Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Radicación	15 288236 0000 0000	2015-12-03 11:06:32	
Trámite	11	PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	
Evento	378	FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I	
Actuación	411	PRESENTACION	Folios: 649
Dependencia	2020	DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	
Pago #1	131233	$ 503500	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES
SOLICITUD FASE NACIONAL - PCT

1	**Titulo de la Invención** (200 caractares o espacios máximos)
	COMPUESTO HETEROCÍCLICO DE AMIDA.

2	**Datos del Solicitante / Titular**			
	Nombre:	NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.	**Dirección Electrónica:**	patents@olartemoure.com
	Dirección:	7-1, Kanda-Nishiki-cho 3-chome, Chiyoda-Ku, Tokyo 1010054	**Domicilio/País de constitución:**	JAPON - TOKYO - CHIYODA-KU

Identificación:

- ☐ CEDULA DE CIUDADANIA
- ☐ CEDULA DE EXTRANJERIA
- ☒ EMPRESA EXTRANJERA
- ☐ NIT
- ☐ PASAPORTE

Número: 1038584-

3	**Solicitantes**		
	Apellidos - Nombres o Razón Social	**Tipo**	**Identificación**
1.	NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.	NN	1038584

4	**Datos del Inventor**

Nombre:	Yoshihiko NAKAYA	**Dirección Electrónica:**	patents@olartemoure.com
Dirección:	10-1, Tsuboi-nishi 2-chome, Funabashi-shi, Chiba 2748507	**Domicilio/País de constitución:**	JAPON - CHIBA - FUNABASHI

Identificación:

☐ CEDULA DE CIUDADANIA ☐ CEDULA DE EXTRANJERIA
☐ EMPRESA EXTRANJERA ☐ NIT
☐ PASAPORTE ☒ No Aplica

Número: -

5	**Inventor(es)**

	Apellidos - Nombres	**Domicilio**
1.	NAKAYA Yoshihiko	JAPON
2.	TANIMA Daisuke	JAPON
3.	INABA Masamitsu	JAPON
4.	MIYAKADO Yuuki	JAPON
5.	FURUHASHI Takamasa	JAPON
6.	MAEDA Kazushige	JAPON

6	**Datos Inventor(es)**

	País de Residencia	**Departamento/Estado**	**Ciudad**	**Dirección**
1.	JAPON	CHIBA	FUNABASHI	10-1, Tsuboi-nishi 2-chome, Funabashi-shi, Chiba 2748507

2.	JAPON	CHIBA	FUNABASHI	10-1, Tsuboi-nishi 2-chome, Funabashi-shi, Chiba 2748507
3.	JAPON	CHIBA	FUNABASHI	10-1, Tsuboi-nishi 2-chome, Funubashi-shi, Chiba 2748507
4.	JAPON	SAITAMA	SHIRAOKA	1470, Shiraoka, Shiraoka-shi, Saitama 3490294
5.	JAPON	SAITAMA	SHIRAOKA	1470, Shiraoka, Shiraoka-shi, Saitama 3490294
6.	JAPON	CHIBA	FUNABASHI	10-1, Tsuboi-nishi 2-chome, Funabashi-shi, Chiba 2748507

7	**Datos del Representante Legal / Apoderado**		
Nombre:	CARLOS R. OLARTE GARCIA	**Dirección Electrónica:**	patents@olartemoure.com
Dirección:	Cra. 5ta No. 34-03	**Domicilio/País de constitución:**	COLOMBIA - BOGOTA D.C. - BOGOTA D.C.

Identificación:

☒ CEDULA DE CIUDADANIA ☐ CEDULA DE EXTRANJERIA

☐ EMPRESA EXTRANJERA ☐ NIT

☐ PASAPORTE

Número: 79782747-

Presentación de Poder

Año de Radicación	
Número de Radicación	

8	**Datos Solicitud: PCT / WO**		
Número Solicitud:	PCT/JP2014/064492	**Fecha Solicitud:**	30/05/2014
Número Publicacion:	WO2014/192936	**Fecha Publicacion:**	04/12/2014

9	**Declaraciones de prioridad**	☒ SI ☐ NO

	(33) País de origen	Codigo del país	(31) No. Solicitud	(32) Fecha
1.	ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA	US	2013-115196	31/05/2013
2.	ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA	US	2013-217697	18/10/2013
3.	ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA	US	2014-013999	29/01/2014
4.	ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA	US	2014-072736	31/03/2014

10	**Reivindicaciones**		
Número reivindicaciones:	12	**Pago Reivindicaciones:**	No

11 Reducción de tasas.

Declaro que carezco de medios económicos para presentar la solicitud de patente.

☐ SI ☒ NO

Nota: En caso de ser persona natural y carecer de medios económicos, y por lo tanto, aplique la reducción de tasas a que se refiere la resolucón vigente en tarifas, debe firmar la presente solicitud bajo la gravedad de juramento.

☐ Micro, pequeñas y medianas empresas
☐ Universidades públicas o privadas
☐ Entidades sin ánimo de lucro

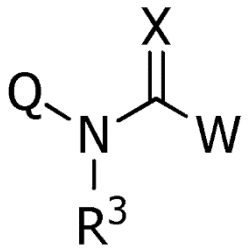
Debe aportar los documentos que se indican en el numeral 17 de anexos

12 Documentos Anexos

☒ Reivindicaciones
☒ Descripción
☐ Dibujos y/o Figuras
☒ Resumen
☐ Certificado Depósito Material Biológico
☐ Uso de Conocimiento tradicional
☐ Listado de secuencias
☐ Artes finales 12 x 12 cm
☒ Poderes, si fuere el caso
☒ Copia de la primera solicitud si se reivindica prioridad
☒ Traducción simple de la primera solicitud, si se reivindica prioridad
☒ Otros Anexos

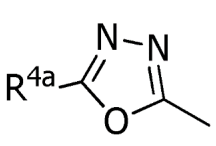
REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de amida heterocíclica de Formula (I):

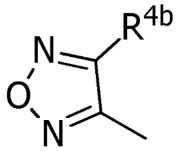


(1)

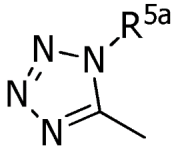
[Donde Q es un heterociclo aromático de cualquiera de Q1 a Q5;



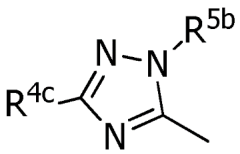
Q-1



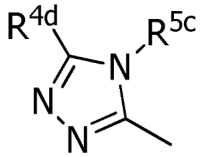
Q-2



Q-3

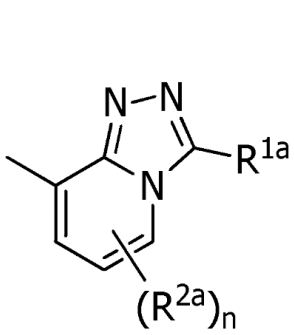


Q-4

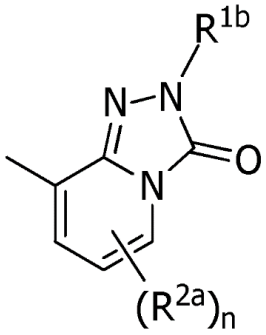


Q-5

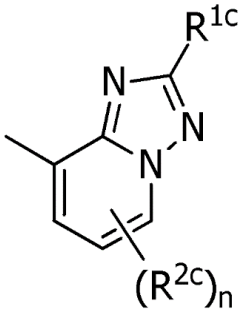
W es un heterociclo aromático de W-1, W-2 o W-3;



W-1



W-2



W-3

X es un átomo de oxigeno o de azufre;

R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquiloC_{3-6}, (cicloalquiloC_{3-6}) opcionalmente sustituido con

R^6, alqueniloC$_{2-6}$, alquiniloC$_{2-6}$, cicloalqueniloC$_{3-6}$, - C(O)R^8, -C(O)OR^{16}, ciano, -OR^9, -S(O)$_{m1}$ R^{10}, -N(R^{11})R^{12}, -C(=N^{12b})R^{8b}, fenilo, fenilo sustituido con (R^7) $_p$, naftilo o cualquier grupo de U-1 a U-25;

R^{1b} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquiloC$_{3-6}$, (C$_{3-6}$)cicloalquilo opcionalmente sustituido con R^6, alqueniloC$_{2-6}$, alquiniloC$_{2-6}$, fenilo, fenilo sustituido con (R^7)$_p$, naftilo, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}) ;

$R^{1\,c}$ es alquiloC1-6;

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, C$_{1-6}$ haloalquilo, - C (O) R^{18}, -C (O) OR^{24}, ciano, nitro, -OR^{19},-S(O) $_{m3}$ R^{20}, R -N (R^{21})R^{22}, fenilo o fenilo sustituido con (R^7)$_p$; cuando n es un entero de 2 o más, R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes unos de otros, y cuando son dos R^{2a} son adyacentes, las dos adyacentes R^{2a} opcionalmente forman un anillo de 6 miembros con átomos de carbono ligados a cada R^{2a} formando -CH = CH-CH = CH-;

$R^{2\,c}$ es haloalquiloC$_{1-6}$;

R^3 es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C$_{3-6}$, halocicloalquilo C$_{3-6}$, alquenilo C$_{2-6}$, haloalquenilo C$_{2-6}$, alquinilo C$_{2-6}$, haloalquinilo C$_{2-6}$, -C (O) R^{25} o - C (O) OR^{26};

R^{4a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C$_{3-6}$, (cicloalquilo C$_{3-6}$) opcionalmente sustituido con R^{27}, alquenilo C$_{2-6}$, haloalquenilo C$_{2-6}$, alquinilo C$_{2-6}$, haloalquinilo C$_{2-6}$, cicloalquenilo C$_{3-6}$, -NH_2, alquilamina C$_{1-6}$, di(alquilC$_{1-6}$) amina, -NHC(O)R^8, fenilo, fenilo sustituido con (R^{28})$_r$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}) ;

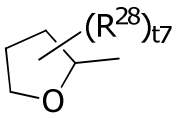
R^{4b} es un átomo de hidrógeno, un halógeno átomo, ciano, nitro, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C$_{3-6}$, cicloalquilo (C,$_{3-6}$) opcionalmente sustituido con R^{27}, alquenilo C$_{2-6}$, haloalquenilo C$_{2-6}$, alquinilo C$_{2-6}$, haloalquinilo C$_{2-6}$, cicloalquenilo C$_{3-6}$, -C (O) OR^{16}, -OR^{38},-S(O)$_{m3}$$R^{20}$, -$NH_2$, alquilamina C$_{1-6}$, di(alquiloC1-6) amina, - NHC(O)R^8, fenilo, fenilo sustituido con (R^{28})$_r$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros

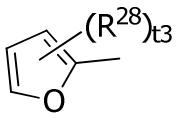
(opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

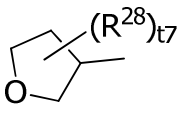
R^{4c} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^{27}, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros, o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

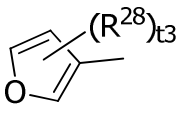
R^{4d} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{35};

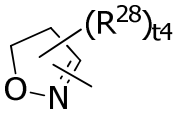
U-1 a U-6, U-6a, U-7 a U-10, U-10, U-11, U-11, U-12, U-12a, U-13, U-13, U-14 U-22, U-22a, U-23, U-24, U-25 y U-26 son heterociclos respectivos de las siguientes estructuras;

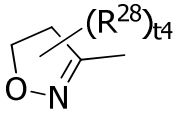

U-1

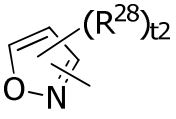

U-2

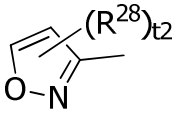

U-3

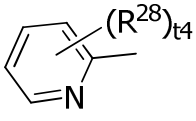

U-4

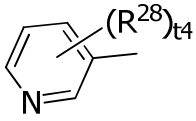

U-5

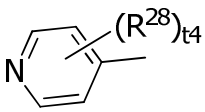

U-5a

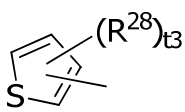

U-6

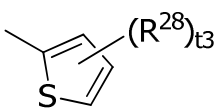

U-6a

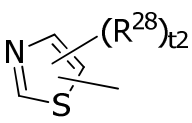

U-7

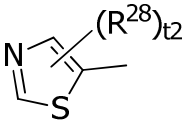

U-8

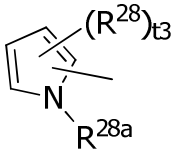

U-9

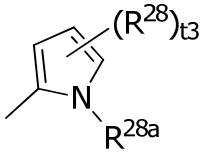

U-10

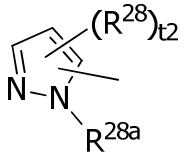

U-10a

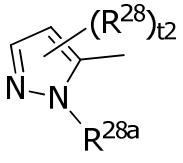

U-11

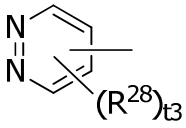

U-11a

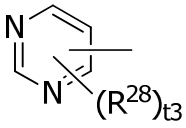

U-12

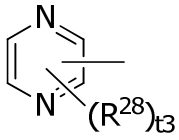

U-12a

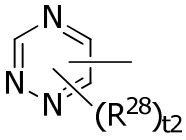

U-13

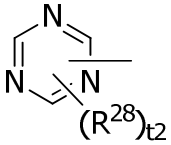

U-13a

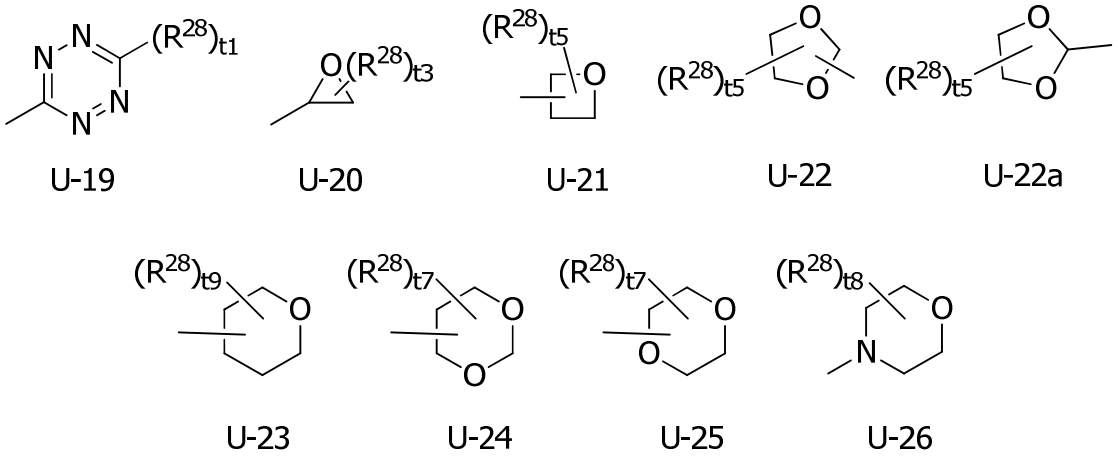

U-14


U-15


U-16


U-17


U-18



R^{5a} y^{5b} de la R son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquiloC_{3-6}, halocicloalquiloC_{3-6}, alqueniloC_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, haloalquiniloC_{2-6}, cicloalqueniloC_{3-6}, fenilo o fenilo sustituido con $(R^{28})_r$;

R^{5c} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{36} o R^{5c} opcionalmente forma un anillo de 6 miembros con un átomo de nitrógeno al que R^{5c} está unido y un átomo de carbono al que R^{4d} se enlaza mediante la formación de $-(CH_2)_4-$ o -CH = CH-CH = CH-R^{4d};

R^6 es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquiloC_{3-6}, - C (O) R^8, -C (O) OR^{16}, $-OR^{13}$,-S(O)$_{m2}$ R^{14}, fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$;

R^7 es un halógeno átomo, ciano, nitro, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquiloC_{3-6}, halocicloalquiloC_{3-6}, alqueniloC_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6}, alquilcarbonilo C_{1-6}, cicloalquilcarbonilo C_{3-6}, haloalquilcarbonilo C_{1-6}, halocicloalquilcarbonilo C_{3-6}, alcoxilcarbonilo C_{1-6}, halo alcoxilcarbonilo C_{1-6}, alquilaminocarbonilo C_{1-6}, haloalquilaminocarbonilo C_{1-6}, di(alquilaminoC_{1-6})carbonilo, -OR^{15},-S(O)$_{m3}$$R^{20}$, alquilaminosulfonilo C_{1-6}, di(alquiloC1-6)aminosulfonilo, $-NH_2$, alquilaminoC_{1-6}, di(alquiloC1-6) amino, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

R^8 es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o -N (R^{11a}) R^{12a};

R^{8b} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^9 es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o fenilo;

R^{10} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6} o haloalquinilo C_{2-6};

R^{11} y R^{12} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquiloC_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, fenilsulfonilo, fenilo, fenilo sustituido $(R^7)_p$, U-7, U-8, U-9 y U-14 y U-19 o R^{11} opcionalmente forma un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al cual R^{11} y R^{12} se adhieren formando una cadena de C_{2-6} alquileno junto con R^{12}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene uno O, S, S(O), $S(O)_2$, o $N(R^{33})$ y es opcionalmente sustituido con un grupo oxo o un grupo tioxo;

R^{11a} y R^{12a} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, o fenilo, o R^{11a} opcionalmente forma un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al cual R^{11a} y R^{12a} están unidos formando una cadena de alquileno C_{2-6} con R^{12a}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene uno O , S, S(O), $S(O)_2$, o N (R^{33}) y es opcionalmente sustituido con un grupo oxo o un grupo de tioxo;

R^{12b} -OR^{19b};

R^{13} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, - C (O) R^8 o fenilo;

R^{14} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6} o fenilo;

R^{15} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6} o cicloalquenilo C_{3-6};

R^{16} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{37};

R^{18} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{19} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o fenilo;

R^{19b} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{20} es alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6} o cicloalquenilo C_{3-6};

R^{21} y^{22} de la R son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, o fenilo, o R^{21} opcionalmente forma un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al cual R^{21} y R^{22} están unidos formando una cadena de C_{2-6} alquileno con R^{22}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene uno O , S, S(O), $S(O)_2$, o N (R^{39}) y está opcionalmente sustituido con un grupo oxo o un grupo de tioxo;

R^{24} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{25} y R^{26} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, haloalquiloC_{1-6}, cicloalquiloC_{3-6}, halocicloalquiloC_{3-6}, alqueniloC_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6} o fenilo;

R^{27} es un átomo de halógeno, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido $(R^{28})_r$, -C (O) OR^{16}, -OR^{29}, -S(O) $_{m4}$ R^{30}, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

R^{28} es un halógeno átomo, ciano, nitro, alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alqueniloC_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, (C_{1-6} alcoxilo) alquiloC1-6, -OR^{31} o -$S(O)_{m4}R^{30}$; cuando t2, t3, t4, t5, t7, t8 o t9 es un entero de 2 o más, las R^{28} opcionalmente son iguales o diferentes entre sí; más cuando dos R^{28} son adyacentes, las dos adyacentes R^{28} opcionalmente forman un anillo de 6 miembros con átomos de carbono para que cada R^{28} se una formando -CH = CH-CH = CH-;

R^{28a} es alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, (alcoxilo C_{1-6}) alquiloC1-6 o alquiloC1-6 (C_{1-6} alquiltio);

R^{29}, R^{30} y R^{31} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6} o fenilo;

R^{33} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C_{3-6}, - C (O) R^8, -C (O) OR^{16}, -OR^{33},-$S(O)_{m6}R^{33}$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-1 U-3, U-7, U-8, U-9 y U-14 a U-25;

R^{35} es un átomo de halógeno o alcoxilo C_{1-6};

R^{35} es un átomo de halógeno o alcoxilo C_{1-6};

R^{36} es un átomo de halógeno o alcoxilo C_{1-6};

R^{37} es alcoxilo C_{1-6},

R^{38} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6} o fenilo;

R^{39} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

T1 es un entero de 0 o 1;

m1, m2, m3, m4, m6 y T2 son cada uno independientemente un número entero de 0, 1 o 2;

n y T3 son cada uno independientemente un número entero de 0, 1, 2 o 3;

p y r son cada uno independientemente un número entero de 1, 2, 3, 4 o 5;

T4 es un entero de 0, 1, 2, 3 o 4;

T5 es un entero de 0, 1, 2, 3, 4 o 5;

T7 es un entero de 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

T8 es un entero de 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 y 8; y

T9 es un entero de 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8 o 9] o una sal del mismo.

2. El compuesto de amida heterocíclica o su sal según la reivindicación 1, en donde W es un heterociclo aromático de W-1 o W-2; y

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, - C (O) R^{18}, -C (O) OR^{24}, ciano, nitro, -OR^{19}, o-$S(O)_{m3}R^{20}$, y cuando n es un entero de 2 o más, las R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes unos de otros.

3. El compuesto de amida heterocíclica o su sal según la reivindicación 2, donde R^{1b} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquilo C_{3-6}, (cicloalquilo C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6, alquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, naftilo o cualquier grupo de U-1 a U-25;

R^{4a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, (cicloalquilo C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^{27}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6}, -NH_2, alquilamino C_{1-6}, di(alquilC_{1-6}) amino, -NHC(O) R^8, fenilo , fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, o cualquier grupo de U-1 a U-26;

R^7 es un átomo de halógeno, ciano, nitro, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquiloC_{3-6}, halocicloalquiloC_{3-6}, alqueniloC_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6},

alquiniloC$_{2-6}$, haloalquinilo C$_{2-6}$, cicloalquenilo C$_{3-6}$, alquilcarbonilo C$_{1-6}$, cicloalquilcarbonilo C$_{3-6}$, haloalquilcarbonilo C$_{1-6}$, halocicloalquilcarbonilo C$_{3-6}$, alcoxilcarbonilo C$_{1-6}$, haloalcoxilcarbonilo C$_{1-6}$, alquilaminocarbonilo C$_{1-6}$, haloalquilaminocarbonilo C$_{1-6}$, di(alquilC$_{1-6}$ amino) carbonilo, -OR^{15},-S(O) $_{m3}$ R^{20}, alquilaminosulfonilo C$_{1-6}$, di(alquiloC1-6) aminosulfonilo, -NH$_2$, alquilamino C$_{1-6}$, di (alquil C$_{1-6}$) amino, o cualquier grupo de U-1 a U-26; y

R^{27} es un átomo de halógeno, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido (R^{28})$_r$, -C (O) OR^{16}, -OR^{29} ,-S(O) $_{m4}$ R^{30}o cualquier grupo de U-1 a U-26.

4. El compuesto de amida heterocíclica o su sal según la reivindicación 3, donde R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquilo C$_{3-6}$, (cicloalquilo C$_{3-6}$) opcionalmente sustituido con R^6, alquenilo C$_{2-6}$, alquinilo C$_{2-6}$, cicloalquenilo C$_{3-6}$, - C (O) R^8, -OR^9,-S(O)$_{m1}$R^{10} , -N (R^{11}) R^{12}, -C (= N^{12b}) R^{8b}, fenilo, fenilo sustituido (R^7)$_p$, U- 3, U-5a, U-6a, U-7, U-8, U-10a, U-11a, U-12a o U-13a;

R^{1b} es alquiloC1-6 o alquiloC1-6 opcionalmente sustituido con R^6;

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, haloalquilo C$_{1-6}$ o -S(O) $_{m3}$ R^{20}, y cuando n es un entero de 2 o más, las R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí;

R^3 es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{4a} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, C$_{3-6}$ cicloalquilo, fenilo, fenilo sustituido con (R^{28})$_r$ o un heterociclo de U-1, U 2, U-7, U-10 y U-26;

R^{4b} es alquiloC1-6;

R$^{4\,c}$ es un átomo de hidrógeno;

R$^{d\,4}$ es alquiloC1-6;

R^{5a} es un átomo de hidrógeno alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, C$_{2-6}$ alquenilo o fenilo;

R^{5b} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R$^{5\,c}$ es alquiloC1-6, o R^{5c} opcionalmente forma un anillo de 6 miembros con un átomo de nitrógeno y que R^{5c} está unido un átomo de carbono a que R^{4d} se enlaza mediante la formación -(CH$_2$)$_4$- o -CH = CH-CH = CH-R^{4d};

R^7 es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, o -OR^{15};

R^{8b} es un átomo de hidrógeno;

R^{9} es alquiloC1-6;

R^{10} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6} o alquinilo C_{2-6};

R^{11} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, fenilsulfonilo, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{7})_{p}$ o U-7;

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{11} opcionalmente forma un anillo de 5-6 miembros junto con un átomo de nitrógeno al cual R^{11} y R^{12} están unidos formando una cadena de C_{4-5} alquileno junto con R^{12}, y en este caso, la cadena de alquileno opcionalmente contiene un O, S, S(O) o $S(O)_2$;

R^{11a} es alquiloC1-6;

R^{12a} es un átomo de hidrógeno;

R^{13} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, - C (O) R^{8} o fenilo;

R^{14} es alquiloC1-6 o (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{15} es alquiloC1-6;

R^{19b} es alquiloC1-6;

R^{20} es alquiloC1-6;

R^{27} es un átomo de halógeno, fenilo, fenilo sustituido $(R^{28})_{r}$, $-OR^{29}$, -C (O) OR^{16} o $-S(O)_{m4}R^{30}$;

R^{28} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, o $-OR^{31}$; cuando t2, t3, t4, t5 y t7 es un entero de 2 o más, las R^{28} opcionalmente son iguales o diferentes entre sí; y más cuando dos R^{28} son adyacentes, las dos adyacentes R^{28} opcionalmente forman un anillo de 6 miembros con átomos de carbono para que cada R^{28} se une formando -CH = CH-CH = CH-;

R^{29} es alquiloC1-6;

R^{30} es alquiloC1-6;

R^{31} es alquiloC1-6;

R^{33} es alquiloC1-6; y

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano, C_{3-6} cicloalquilo, - C (O) R^{8}, -C (O) OR^{16}, $-OR^{33}$,$-S(O)_{m6}R^{33}$, fenilo, fenilo sustituido $(R^{7})_{p}$, U-1, U-8 y U-22a.

5. El compuesto de amida heterocíclica o su sal según la reivindicación 4 en donde Q es un heterociclo aromático de Q-1; y W es un heterociclo aromático de W-1.

6. El compuesto de amida heterocíclica o su sal según la reivindicación 5, en donde X es un átomo de oxígeno;

R^{1a} un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquilo C_{3-6}, (cicloalquilo C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6, alquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6}, $-C(O)R^8$, $-OR^9$, $-S(O)_{m1}R^{10}$, $-N(R^{11})R^{12}$, $-C(=N^{12b})R^{8b}$, fenilo , fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-5a, U-6a, U-7, U-8, U-10a, U-11a, U-12a o U-13a;

R^{2a} es alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6} o $-S(O)_{m3}R^{20}$, cuando n es un entero de 2 o más, los R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí;

R^6 es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquiloC_{3-6}, $-C(O)R^8$, $-C(O)OR^{16}$, $-OR^{13}$,$-S(O)_{m2}R^{14}$ o fenilo sustituido con $(R^7)_p$; y

R^{27} es un halógeno átomo, fenilo, $-OR^{29}$ o $-S(O)_{m4}R^{30}$.

7. El compuesto de amida heterocíclica o su sal según la reivindicación 6, en donde R^{4a} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27} o C_{3-6} cicloalquilo; y

R^{27} es un átomo de halógeno o $-OR^{29}$.

8. El compuesto de amida heterocíclica o su sal según la reivindicación 4, en donde Q es un heterociclo aromático de Q-3; y W es un heterociclo aromático de W-1.

9. El compuesto de amida heterocíclica o su sal según la reivindicación 8, donde R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquiloC_{3-6}, (cicloalquiloC_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6, alquenilo C_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, $-C(O)R^8$, $-S(O)_{m1}R^{10}$, $-N(R^{11})R^{12}$, fenilo, fenilo sustituido $(R^7)_p$, U- 3, U-5a, U-6a, U-8, U-10a o U-13a;

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, o haloalquiloC_{1-6} y cuando n es un entero de 2 o más, R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí;

R^6 es un átomo de halógeno, - C (O) OR^{16}, $-OR^{13}$, $-S(O)_{m2}R^{14}$o fenilo sustituido con $(R^7)_p$;

R^7 es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, o $-OR^{15}$;

R^8 es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{11} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$;

R^{11} opcionalmente forma un anillo de 6 miembros con un átomo de nitrógeno al cual R^{11} y R^{12} están unidos formando una cadena de alquileno C5 junto con R^{12}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene un O, S, S(O) o $S(O)_2$;

R^{16} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{27} es fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, $-OR^{29}$, -C (O) OR^{16} o $-S(O)_{m4}R^{30}$;

R^{28} es un átomo de halógeno o alquiloC1-6; y

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C_{3-6}, $-OR^{33}$, $-S(O)_{m6}R^{33}$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-1 y U-8.

10. el compuesto amida heterocíclicos, o la sal misma según la reivindicación 9, en donde R^{5a} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27} o alquenilo C_{2-6}; y

R^{27} es $-OR^{29}$ o $-S(O)_{m4}R^{30}$.

11. Un químico agrícola que comprende uno o dos o más compuestos seleccionados del compuesto de amida heterocíclica y la sal mismo, como en las reivindicaciones 1 o 2, como un componente activo.

12. Un herbicida que comprende uno o dos o más de los compuestos seleccionados del compuesto de amida heterocíclica y la sal mismo, como en las reivindicación 1 o 2, como un componente activo.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2014/064492

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
C07D471/04(2006.01)i, *A01N43/90*(2006.01)i, *A01P13/02*(2006.01)i

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
C07D471/04, A01N43/90, A01P13/02

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAplus/REGISTRY(STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2012/028579 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG), 08 March 2012 (08.03.2012), entire text; particularly, claim 1 & JP 2013-536817 A & US 2012/0058892 A1 & EP 2611785 A & AU 2011298424 A & CA 2809487 A & CN 103282354 A & EA 201390265 A & MX 2013001937 A & KR 10-2013-0101506 A & UY 33583 A & TW 201221059 A & AR 82828 A & CO 6670599 A	1-12
A	WO 2012/123409 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG), 20 September 2012 (20.09.2012), entire text; particularly, claim 1 & EP 2686315 A & AU 2012228355 A & CA 2830089 A & MX 2013010395 A & CN 103596945 A & AR 85678 A	1-12

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
06 August, 2014 (06.08.14)	19 August, 2014 (19.08.14)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office Facsimile No.	Authorized officer Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2014/064492

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2012/123416 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG), 20 September 2012 (20.09.2012), entire text; particularly, claim 1 & EP 2686316 A & CN 103459386 A & AR 85811 A	1-12
A	WO 2012/126932 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG), 27 September 2012 (27.09.2012), entire text; particularly, claim 1 & EP 2688885 A & AU 2012230388 A & CA 2830773 A & MX 2013010678 A & CN 103596946 A & AR 85469 A	1-12
A	WO 2013/017559 A1 (BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH), 07 February 2013 (07.02.2013), entire text; particularly, claim 1 & AR 87385 A1 & CN 103717581 A & EP 2739611 A1	1-12
A	WO 2013/064457 A1 (BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH), 10 May 2013 (10.05.2013), entire text; particularly, claim 1 & EP 2589598 A1	1-12
A	WO 2013/072402 A1 (BASF SE), 23 May 2013 (23.05.2013), entire text; particularly, claim 1 (Family: none)	1-12
A	JP 2007-506788 A (Rigel Pharmaceuticals, Inc.), 22 March 2007 (22.03.2007), entire text; particularly, claim 1 & US 2005/0090521 A1 & US 2007/0149520 A1 & EP 1668009 A & WO 2005/030774 A1 & CA 2540021 A	1-12

讀波社 (JDCP)

特許 6287-04
整内 GF-9131

OLARTEMOURE

OLARTE MOURE & ASOCIADOS LTDA.

Carlos R. Olarte
Juan G. Moure

Alexander Agudelo
Carlos A. Parra
Juan F. Acosta
Andrés Rincón
Mónica Guevara
Andrés Alvarado
María C. Calderón
Mauricio Ávila
Gina Cáceres
Isabella Herrera
Zaava Ravid
Alejandro Moure
Miguel F. Porras
Catalina Amaya
Laura M. Escobar
Lorena Andrade
Sergio Arboleda
Catalina Jiménez
Daniela González
Maritza Sierra
Gina A. Arias
Guillermo Parra
Erika Jhiset Suárez

Medellín
María C. Múnera
Eddie Manotas
Adrián Santamaría
Camilo A. Bernal

Barranquilla
Gina De Echeona
José J. Dangond

ASSIGNMENT

1. **Yoshihiko NAKAYA**
2. **Daisuke TANIMA**
3. **Masamitsu INABA**
4. **Yuuki MIYAKADO**
5. **Takamasa FURUHASHI**
6. **Kazushige MAEDA**

by means of this document and in consideration of the payment by the Assignee to the Assignor of a good and valuable consideration, assign(s) to

- **Inventor Nos. 1, 2, 3 and 6:**
  c/o Nissan Chemical Industries, Ltd. Chemical Research Laboratories

- **Inventor Nos. 4 and 5:**
  c/o Nissan Chemical Industries, Ltd. Biological Research Laboratories

organized under the laws of

- **Inventor Nos. 1, 2, 3 and 6: Chiba, Japan**

- **Inventor Nos. 4 and 5: Saitama, Japan**

Domiciled in

- **Inventor Nos. 1, 2, 3 and 6:**
  10-1, Tsuboi-nishi 2-chome, Funabashi-shi, Chiba 2748507, Japan

- **Inventor Nos. 4 and 5:**
  1470, Shiraoka, Shiraoka-shi, Saitama 3490294, Japan

(hereinafter referred to as the "ASSIGNEE".), and be it
all my (our) rights, title and interest in and to my (our) invention for a new and useful improvement entitled and as fully set forth and described in:

HETEROCYCLIC AMIDE COMPOUND

CESION

por medio de la presente y a cambio del pago de una contraprestación económica, cedo (cedemos) a

organizada bajo las leyes de

domiciliada en

(de ahora en adelante el "CESIONARIO".),

todos mis (nuestros) derechos, título e interés sobre mi (nuestra) invención tal como describe en:

So far as the Republic of Colombia is concerned.

en lo que concierne a la República de Colombia.

November 25, 2015
Yoshihiko NAKAYA
Place, date: Chiba, Japan
Assignor: Yoshihiko NAKAYA

Lugar, fecha
Cedente(s) (Firma)

November 25, 2015
Daisuke TANIMA
Place, date: Chiba, Japan
Assignor: Daisuke TANIMA

Lugar, fecha
Cedente(s) (Firma)

November 25, 2015
Masamitsu INABA
Place, date: Chiba, Japan
Assignor: Masamitsu INABA

Lugar, fecha
Cedente(s) (Firma)

November 25, 2015
Yuuki MIYAKADO
Place, date: Saitama, Japan
Assignor: Yuuki MIYAKADO

Lugar, fecha
Cedente(s) (Firma)

November 25, 2015
Takamasa FURUHASHI
Place, date: Saitama, Japan
Assignor: Takamasa FURUHASHI

Lugar, fecha
Cedente(s) (Firma)

November 25, 2015
Kazushige MAEDA
Place, date: Chiba, Japan
Assignor: Kazushige MAEDA

Lugar, fecha
Cedente(s) (Firma)

NO LEGALIZATION IS REQUIRED

LISTA DE INVENTORES

PCT/JP2014/064492

Yoshihiko NAKAYA
10-1, Tsuboi-nishi 2-chome,
Funabashi-shi,
Chiba 2748507
Japón

Daisuke TANIMA
10-1, Tsuboi-nishi 2-chome,
Funabashi-shi,
Chiba 2748507
Japón

Masamitsu INABA
10-1, Tsuboi-nishi 2-chome,
Funabashi-shi,
Chiba 2748507
Japón

Yuuki MIYAKADO
1470, Shiraoka,
Shiraoka-shi,
Saitama 3490294
Japón

Takamasa FURUHASHI
1470, Shiraoka,
Shiraoka-shi,
Saitama 3490294
Japón

Kazushige MAEDA
10-1, Tsuboi-nishi 2-chome,
Funabashi-shi,
Chiba 2748507
Japón

No.	R^{1a}	$(R^{2a})n$	Punto de Fusión (°C)
C1-49	D-16a	5-CF_3	159-164
C1-50	C≡CMe	5-CF_3	234-238
C1-51	CH_2CF_3	5-CF_3	168-171
C1-52	CH_2CN	5-CF_3	227-231
C1-53	D-16m	5-CF_3	118-120
C1-54	D-24f	5-CF_3	169-170
C1-55	$(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	104-105

[Ejemplo de Referencia 4]

ácido 3- (etiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Paso 1; Síntesis del ácido 3-(tioxo)-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

A 20 ml de solución de metanol de 2.0 g de 3-tioxo-5- (trifluorometil) -2,3-dihidro-[1,2,4] triazolo [4,3-a] piridina-8-carboxilato de metilo sintetizado por un método similar al de la Etapa 1 del Ejemplo de Síntesis 8 que contiene imidazol, se añadió 17 ml de 0.5 mol/L de solución acuosa de hidróxido de sodio bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 3.5 horas. Después de terminar la reacción, se añadió 20 ml de 1 mol/L de ácido clorhídrico a la solución de reacción y el sólido precipitado en la solución de reacción se separó mediante filtración. El sólido obtenido se lavó con 1 mol/L de ácido clorhídrico, agua y eter diisopropilico en este orden y se filtró para proporcionar 1.1 g del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 235°C a 240°C

Paso 2; Síntesis del ácido 3-(etiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

A 10 ml de solución del ácido N,N-dimetilformamida de 700 mg (2.66 mmol) de 3-(tioxo)-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico, se añadió 898 mg (5.76 mmol) de yoduro de etilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 4 días. Después terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. Al residuo obtenido, se añadió 5 ml de agua y 5 ml de 1 mol/L de ácido clorhídrico y el sólido precipitado se separó mediante filtración. El sólido obtenido se lavó con agua y eter diisopropilico en este orden para proporcionar 486 mg del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 113°C a 114°C

[Ejemplo de Referencia 5]

Los siguientes compuestos fueron sintetizados por métodos similares a los Pasos 2 y 3 del Ejemplo de Síntesis 8 o Ejemplo de Referencia 4.

3- (isopropiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 120°C a 122°C

ácido 3- (isopropiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 135°C a 136°C

Ácido 3-((2-metoxietil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 106°C a 111°C

Ácido 3-(aliltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 96°C a 99°C

Ácido 3-(prop-2-in-1-iltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 179°C a 181°C

3- (n-propiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 87°C a 88°C

Ácido 3-(n-propiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 106°C a 108°C

3-(isobutiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 105°C a 106°C

Ácido 3-(isobutiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 110°C a 112°C

3-(s-butiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 88°C a 90°C

Ácido 3-(s-butiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 107°C a 109°C

3-(benciltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 130°C a 135°C

Ácido 3-(benciltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 153°C a 156°C

3-((4-metoxibencil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 119°C a 121°C

Ácido 3-((4-metoxibencil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 180°C a 182°C

3-((ciclopropilmetil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 122°C a 123°C

Ácido 3-((ciclopropilmetil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 127°C a 129°C

3-(((tetrahidrofuran-2-il)metil))tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

^{1}H NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 7.95 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.42 (d, 1H, J=7.2Hz), 4.34-4.25 (m, 1H), 4.09 (s, 3H), 3.92-3.84 (m, 1H), 3.79-3.68 (m, 2H), 3.56-3.49 (m, 1H), 2.17-2.06 (m, 1H), 1.99-1.87 (m, 2H), 1.76-1.68 (m, 1H).

Ácido 3-(((tetrahidrofuran-2-il)metil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 108°C a 112°C

3-((cianometil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 146°C a 148°C

Ácido 3-((cianometil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 138°C a 140°C

3-((2-oxopropil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 84°C a 87°C

Ácido 3-((2-oxopropil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 121°C a 124°C

3-((1,3-dioxan-2-il)metil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 99°C a 102°C

Ácido 3-((1,3-dioxolan-2-il)metil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 110°C a 112°C

Ácido 3-((2,2,2-trifluorometil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 150°C a 151°C

Ácido 3-((2-metoxi-2-oxoetil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 143°C a 144°C

3-(ciclopentiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 92°C a 94°C

Ácido 3-(ciclopentiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 143°C a 146°C

3-(((6-cloropiridin-3-il)metil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 99°C a 100°C

3-(((6-cloropiridin-3-il)metil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato

Punto de fusión: 159°C a 160°C

[Ejemplo de Referencia 6]

Síntesis de 2-metil-3-oxo-5- (trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

A la mezcla de 500 mg (1.91 mmol) de 3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo, 525 mg (3.82 mmol) de carbonato de potasio y 10 ml de acetonitrilo, se añadió 298 mg (2.10 mmol) de yoduro de metilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 5 horas. Después de terminar la reacción, se añadió 20 ml de cloroformo a la solución de reacción y el sólido precipitado se separó mediante filtración. El solvente en la solución obtenida mediante la filtración se separó por destilación bajo presión reducida. El residuo obtenido después de destilar el solvente se purificó con cromatografía líquida preparativa de presión media eluyendo el residuo con acetato de n-hexano-etilo (gradiente de 17:1 a 2:3) para proporcionar 312 mg del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 189°C a 190°C

Los siguientes compuestos fueron sintetizados por un método similar.

2-etil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 135°C a 137°C

2-isopropil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 124°C a 125°C

2-bencil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 99°C a 100°C

[Ejemplo de Referencia 7]

Síntesis del ácido 2-metil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

A 3 ml de solución de etanol de 312 mg (1.13 mmol) de 2-metil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo, se añadió 3 ml de solución acuosa de 50 mg (1.25 mmol) de hidróxido de sodio bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a la misma temperatura. Después de terminar la reacción, se añadió 3 ml de mol/L de ácido clorhídrico a la solución de reacción y la mezcla resultante se extrajo con diclorometano (10 ml, 3 vez). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 250 mg del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 155°C a 160°C

Los siguientes compuestos fueron sintetizados por un método similar.

Ácido 2-etil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 160°C a 163°C

Ácido 2-isopropil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 160°C a 162°C

Ácido 2-bencil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 84°C a 86°C

[Ejemplo de Referencia 8]

Síntesis de 3-tioxo-5- (trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

100 mg de la mezcla de 3-tioxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo sintetizado por el método de la Etapa 1 del Ejemplo de Síntesis 8 e imidazol se disolvió en 50 ml de acetato de etilo y la mezcla resultante se lavó con 20 ml 1 mol/Lde ácido clorhídrico. La fase orgánica obtenida se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida para propocionar 63 mg del producto diana como un sólido de color naranja-amarillo.

Punto de fusión: 218°C a 220°C

[Ejemplo de Referencia 9]

Ácido 3-(fenilamino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Paso 1;Síntesis de 2- (2- (fenilcarbamoil) hidrazinilo)-6-(trifluorometil)nicotinato de metilo

A 13 ml de solución de tetrahidrofurano de 500 mg (2.13 mmol) de 2-hidrazinil-6-(trifluorometil) nicotinato de metilo, se añadió 255 mg (2.14 mmol) de isocianato de fenilo bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 14 hora a la misma temperatura. Después terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico para proporcionar 740 mg del producto diana como un sólido blanco.

Punto de fusión: 190°C a 195°C

Paso 2; Síntesis de 3-(fenilamino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

A la solución mixta de 730 mg (2.06 mmol) de 2-(2-(fenilcarbomoil)hidrazinil)-6-(trifluorometil)nicotinato de metilo y 15 ml de tolueno, se añadió 940 mg (6.11 mmol) de cloruro de fosforilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 3 horas con calentamiento a reflujo. Después de terminar la agitación, la mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se añadió a agua helada para terminar la reacción. A partir de entonces, el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (30 ml, 2 vez). La fase orgánica obtenida se secó sobre sulfato de sodio y el solvente se separo por destilación bajo presión reducida. El residuo obtenido se purificó con cromatografía líquida preparativa de presión media

eluyendo el residuo n-hexano-eti-acetato-metanol (gradiente de 10:1 a 0:10) para proporcionar 480 mg del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 225°C a 230°C

Paso 3; Síntesis del ácido 3-(fenilamino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

A la solución mixta de 470 mg (1.40 mmol) de 3-(fenilamino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo y 10 ml de metanol, se añadió 8.0 ml (8.0 mmol) de 1 mol/L de solución acuosa de hidróxido de sodio bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la solución de reacción se agitó durante 3 horas bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida y a partir de entonces se añadió ácido clorhídrico 1 N a la solución de reacción para ajustar el pH entre 5 y 6. El líquido mezclado de reacción se extrajo con acetato de etilo (30 ml, 2 veces) y la fase orgánica obtenida se secó sobre sulfato de sodio anhidro, seguido por separación por destilación del solvente bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico para proporcionar 250 mg del producto diana como un sólido de color naranja.

Punto de fusión: 125°C a 130°C

[Ejemplo de Referencia 10]

Ácido 3-((2-metoxietil(metil)amino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Paso 1; Síntesis de 2-(2-((2-metoxietil)(metil)carbamoil)hidrazinilo) 6-(trifluorometil)nicotinato de etilo

Una mezcla de 500 mg (1.82 mmol) de 3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de etilo, 320 mg (3.59 mmol) de N-(2-metoxietil)metilamina, y 10 ml de tetrahidrofurano se agitó durante 3 horas con calentamiento a reflujo. Después terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. El residuo obtenido se purificó con cromatografía líquida preparativa de presión media eluyendo el residuo con acetato de n-hexano-etilo (gradiente de 90:10 a 0:100) para proporcionar 610 mg del producto diana como un sólido amarillo claro.

Punto de fusión: 65°C a 66°C

Paso 2; Síntesis de 3-((2-metoxietil)(metil)amino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de etilo

A la solución mixta de 595 mg (1.63 mmol) de 2-(2-(2-metoxietil)(metil)carbamoil)hidrazinil)-6-(trifluorometil)nicotinato de etilo y 10 ml de tolueno, se añadió 750 mg (4.94 mmol) de cloruro de fosforilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 1,5 horas con calentamiento a reflujo. Después de terminar la agitación, la mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se añadió a agua helada para terminar la reacción. Posteriormente se añadió solución acuosa de hidrógeno carbonato de sodio para ajustar el pH entre 8 y 9. A partir de entonces, la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (30 ml, 2 veces). La fase orgánica obtenida se secó sobre sulfato de sodio y el solvente se separo por destilación bajo presión reducida. El residuo obtenido se purificó con cromatografía líquida preparativa de presión media eluyendo el residuo con acetato de n-hexano-etilo (gradiente de 90:1 a 10:100) para proporcionar 520 mg del producto diana como un sólido amarillo.

^{1}H NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 7.91 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.80 (d, 1H, J=7.2Hz), 4.55 (q, 2H, J=6.9Hz), 3.75-3.41 (m, 4H), 3.27 (s, 3H), 2.87 (s, 3H), 1.48 (t, 3H, J=6.9Hz).

Paso 3; Síntesis del ácido 3-((2-metoxietil)(metil)amino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

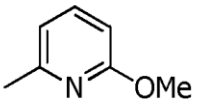
A la solución mixta de 500 mg (1.44 mmol) de 3-((2-metoxoetil)(metil)amino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílato de etilo y 10 ml de etanol, se añadió 4.5 ml (4.5 mmol) de 1 mol/L de solución acuosa de hidróxido de sodio bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 1hora bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida y a partir de entonces se añadió ácido clorhídrico a la solución de reacción para ajustar el pH a 4. El líquido mezclado de reacción se extrajo con acetato de etilo (30 ml, 2 veces) y la fase orgánica obtenida se secó sobre sulfato de sodio anhidro, seguido por separación por destilación del solvente bajo presión reducida para proporcionar 470 mg del producto diana como un sólido amarillo claro.

Punto de fusión: 115°C a 120°C

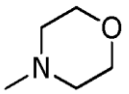
[Ejemplo de Referencia 11]

Los compuestos listados en la Tabla quince fueron sintetizados por un método similar al Ejemplo de Referencia 9 o el Ejemplo de Referencia 10. En las Tablas, Me es un grupo metilo. Del mismo modo, Et es grupo etilo, Ph es un grupo fenilo, y c- es ciclo.

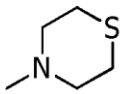
En las tablas, los sustituyentes de D-9b, D-14, D-17, y D-19 tienen las siguientes estructuras.



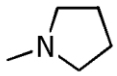
D-9b



D-14

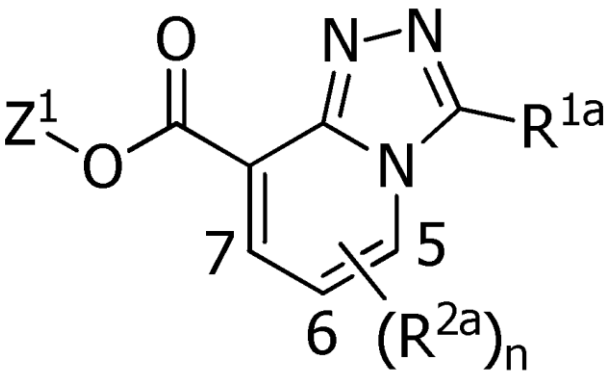


D-17



D-19

[0282] [Quinceava Tabla]



[Tabla 47]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})n$	Z^1	Punto de Fusión (°C)
C2-01	N(Me)Ph	5-CF_3	H	160-170
C2-02	$NHCH(CH_3)_2$	5-CF_3	H	145-146
C2-03	D-14	5-CF_3	H	210-213
C2-04	NH(D-9b)	5-CF_3	H	170-174
C2-05	$NH(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	H	150-155
C2-06	$NHSO_2Ph$	5-CF_3	H	>290
C2-07	D-17	5-CF_3	H	160-165
C2-08	$NH(CH_2)_2SMe$	5-CF_3	H	173-176
C2-09	$NHCH_2CF_3$	5-CF_3	H	180-183
C2-10	$N(Me)CH(CH_3)_2$	5-CF_3	H	135-137
C2-11	N(Me)Hex-c	5-CF_3	H	184-186
C2-12	N(Me)Et	5-CF_3	H	140-141
C2-13	$N(Et)_2$	5-CF_3	H	126-127
C2-14	D-19	5-CF_3	H	150-151
C2-15	$N(Me)CH_2C\equiv CH$	5-CF_3	H	133-134
C2-16	$N(Me)(CH_2)_2CN$	5-CF_3	H	136-137
C2-17	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF_3	H	168-171
C2-18	$N(Me)CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	H	117-118
C2-19	$N(Me)CH_2$(4-MeO-Ph)	5-CF_3	H	105-110

[0283] [Decimosexta Tabla]

[Tabla 48]

No.	^{1}H-NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz)
A1-01a	δ 10.02 (brs, 1H), 8.34 (d, 1H, J=7.8Hz), 8.26 (s, 1H), 8.23 (brs, 1H), 7.11 (d, 1H, J=7.8Hz), 3.96 (s, 3H)。
A1-04a	δ 10.21 (d, 1H, J=6.0Hz), 8.84 (d, 1H, J=5.7Hz), 8.35 (dd, 1H, J=7.2Hz, 0.9Hz), 7.88-7.85 (m, 2H), 7.56-7.46 (m, 3H), 7.08 (d, 1H, J=7.8Hz), 3.98 (s, 3H)。
A1-08a	δ 9.70 (brs, 1H), 9.26 (brs, 1H), 8.32 (d, 1H, J=7.8Hz), 7.07 (d, 1H, J=7.8Hz), 4.21 (s, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.89-3.86 (m, 2H), 3.65-3.62 (m, 2H), 3.40 (s, 3H)。
B1-01a	δ 9.04 (d, 1H, J=1.8Hz), 8.14 (d, 1H, J=6.6Hz), 7.41 (d, 1H, J=6.6Hz), 4.13 (s, 3H)。
B1-02a	δ 7.95 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.44 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.09 (s, 3H), 2.32-2.25 (m, 1H), 1.38-1.33 (m, 2H), 1.22-1.16 (m, 2H)。
B1-04a	δ 8.04 (dd, 1H, J=7.2Hz, 0.6Hz), 7.60-7.42 (m, 6H), 4.14 (s, 3H)。
B1-08a	δ 8.04 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.49 (d, 1H, J=7.2Hz), 5.21 (d, 2H, J=0.9Hz), 4.11 (s, 3H), 3.75-3.72 (m, 2H), 3.54-3.51 (m, 2H), 3.33 (s, 3H)。
B1-27a	δ 8.04 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.45-7.60 (m, 1H), 7.35-7.45 (m, 2H), 7.00-7.15 (m, 1H), 6.90-7.00 (m, 1H), 4.13 (s, 3H), 3.65 (s, 3H)。
B1-29a	δ 8.49 (s, 1H), 8.00-8.15 (m, 1H), 7.75-7.85 (m, 1H), 7.40-7.60 (m, 2H), 4.13 (s, 3H)。
B1-34a	δ 8.17 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.70 (d, 1H, J=8.1Hz), 7.54 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.35-7.45 (m, 2H), 7.20-7.30 (m, 2H), 4.17 (s, 3H), 3.54 (s, 3H)。
B1-49a	δ 8.00 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.54 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.10 (s, 3H), 2.91 (d, 1H, J=7.5Hz), 1.91 (d, 1H, J=7.5Hz), 1.85 (s, 3H)。
C1-01	δ 9.06 (d, 1H, J=1.5Hz), 8.33 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.57 (d, 1H, J=6.9Hz)。 (No se observa el pico del proton CO_2H)
C1-02	δ 8.38 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.60 (d, 1H, H=7.5Hz), 2.39-2.28 (m, 1H), 1.42-1.35 (m, 2H), 1.29-1.23 (m, 2H)。(No se observa el pico del proton CO_2H)
C1-04	δ 8.30 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.60-7.49 (m, 6H)。(No se observa el pico del proton CO_2H)

[0284] Ejemplos de Prueba

Subsecuentemente, la utilidad del compuesto de la presente invención como herbicida será descrita d emanera específica en los siguientes efemplos de Prueba. La presente invención, no obstante, se limita a estos Ejemplos de Prueba.

[Ejemplo de Prueba 1] Prueba de actividad herbicida mediante la aplicación antes de la generación de maleza en condiciones de sumersión.

Después que el suelo aluvial se colocó en 1/10000 en un contenedor Wagner, el agua se vierte y se mezcla para formar una condición sumergida que tiene una profundidad de 4 cm. Malezas def *Echinochloa oryzacola Vasing.*, *Scirpus juncoides*, y *Monochoria vaginali*s se sembraron en una forma mixta en la parte superior del contenedor y a partir de entonces las hojas de la etapa de 2,5

Oryza sativa fueron trasplantadas. En el día de la siembra de semillas, el agente de emulsión que contiene el compuesto de la presente invención preparado de acuerdo con el Ejemplo de Formulación 2 se diluyó con agua de manera que sea una cantidad predeterminada del herbicida y el compuesto diluido se aplicó a la superficie del agua. El contendor se colocó en un invernadero de 25°C a 30°C para que la planta creciera. Tres semanas después de la aplicación de los herbicidas, los efectos sobre cada planta se investigaron de acuerdo con los siguientes criterios. Los resultados se enumeran en la decimoséptima Tabla.

Criterio

5 Porporción herbicida de 90% o más (casi amrchito por completo)

4 Porporción herbicida de 70% o más y menos de 90%

3 Porporción herbicida de 40% o más y menos de 70%

2 Porporción herbicida de 20% o más y menos de 40%

1 Porporción herbicida de 5% o más y menos de 20%

0 Porporción herbicida de 5% o menos (casi no se ve el efecto)

[0285] [Ejemplo de Prueba 1] Prueba de actividad herbicida mediante la aplicación durante de la generación de maleza en condiciones de sumersión.

Después que el suelo aluvial se colocó en 1/10000 en un contenedor Wagner, el agua se vierte y se mezcla para formar una condición sumergida que tiene una profundidad de 4 cm. Malezas def *Echinochloa oryzacola Vasing.*, *Scirpus juncoides*, y *Monochoria vaginali*s se sembraron en una forma mixta en la parte superior del contenedor y a partir de entonces las hojas de la etapa de 2,5 *Oryza sativa* fueron trasplantadas. En el día de la siembra de semillas, el agente de emulsión que contiene el compuesto de la presente invención preparado de acuerdo con el Ejemplo de Formulación 2 se diluyó con agua de manera que sea una cantidad predeterminada del herbicida y el compuesto diluido se aplicó a la superficie del agua. Tres semanas después de la aplicación de herbicidas, los efectos sobre cada planta se investigaron de acuerdo con los criterios del Ejemplo de Ensayo 1. Los resultados se enumeran en la DecimoctavaTabla.

[0286] [Ejemplo de Prueba 3] Prueba de efecto herbicida mediante la aplicación al follaje.

Después que el suelo aluvial se colocó en 1/10000 en un contenedor Wagner, el agua se vierte y se mezcla para formar una condición sumergida que tiene una profundidad de 4 cm. Malezas def *Echinochloa oryzacola Vasing.*, *Scirpus juncoides*, y *Monochoria vaginali*s se sembraron en una forma mixta en la parte superior del contenedor y a partir de entonces las hojas de la etapa de 2,5

Oryza sativa fueron trasplantadas. En el día de la siembra de semillas, el agente de emulsión que contiene el compuesto de la presente invención preparado de acuerdo con el Ejemplo de Formulación 2 se diluyó con agua de manera que sea una cantidad predeterminada del herbicida y el compuesto diluido se aplicó a una parte del tallo y las hojas con un spray de pequeño tamaño. Tres semanas después de la aplicación de herbicidas, los efectos sobre cada planta se investigaron de acuerdo con los criterios del Ejemplo de Ensayo 1. Los resultados se enumeran en la DecimonovenaTabla.

[0287] [Ejemplo de prueba 4] Prueba de efecto herbicida mediante la aplicación al follaje.

El suelo diluvial esterilizado se coloca en una caja de plástico que tiene una longitud de 21 cm, una anchura de 13 cm, y una profundidad de 7 cm. Cada una de las semillas de *Digitaria ciliaris*, *Setaria viridis*, *Echinochloa crus-galli var. crus-galli*, *Avena fatua*, *Alopecurus myosuroides*, *Lolium multiflorum Lam.*, *Apera spica-venti.*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus*, *Chenopodium album*, *Stellaria media*, *Galium spurium*, *Veronica persica*, *Zea mays*, *Glycine max*, *Oryza sativa*, *Triticum aestivum*, *Beta vulgaris ssp. vulgaris*, and *Brassica campestris L.* se sembraron en una manera in situ y como estaba cubierta con el suelo de aproximadamente 1,5 cm de espesor. A continuación, las plantas se cultivaron en el invernadero de 25°C a 30°C. Después de que las plantas se cultivaron durante 14 días, el agente de emulsión que contiene el compuesto de la presente invención preparado de acuerdo con el Ejemplo de Formulación 2 se diluyó con agua de manera que sea una cantidad predeterminada de herbicida y el compuesto diluido se aplica uniformemente a parte del tallo y las hojas con un spray de pequeño tamaño. Tres semanas después de la aplicación de herbicidas, los efectos sobre cada planta se investigaron de acuerdo con los criterios del Ejemplo de Ensayo 1. Los resultados se enumeran en la Vigésima Tabla XX.

[0288] Los símbolos d ela stablas 17 a 20 tienen los siguientes significados:.
A: *Echinochloa oryzicola Vasing.*, B: *Scirpus juncoides*, C: *Monochoria vaginalis*, D: *Leptochloa chinensis*, E: *Cyperus difformis*, F: *Digitaria ciliaris*, G: *Setaria viridis*, H: *Echinochloa crus-galli var. crus-galli*, I: *Avena fatua*, J: *Alopecurus myosuroides*, K: *Lolium multiflorum Lam.*, L: *Apera spica-venti.*, M: *Abutilon theophrasti*, N: *Amaranthus retroflexus*, O: *Chenopodium album*, P: *Stellaria media*, Q: *Galium spurium*, R: *Veronica persica*, a: transplanted *Oryza sativa*, b: directly sowed *Oryza sativa*, c: *Zea mays*, d: *Glycine max*, e: *Triticum aestivum*, f: *Beta vulgaris*

ssp. vulgaris, and g: *Brassica campestris L.*

The application herbicide amount (g/ha) means an amount that a concentration is adjusted so that, when an application amount is converted into per hectare (1 ha), the herbicide is applied by the number of grams (g) of the described value.

[0289] [Decimoséptima Tabla]

[Tabla 49]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C	a
1-001	320	3	2	2	0
1-002	320	2	1	0	0
1-004	320	5	4	4	1
1-005	320	5	4	4	0
1-010	320	5	3		0
1-011	320	5	4	5	1
1-012	320	5	3	4	0
1-014	320	5	4	3	0
1-015	320	2	3	3	0
1-016	320	4	0	0	0
1-017	320	3	2	0	0
1-018	320	1	3	5	0
1-019	320	5	3	4	2
1-020	320	4	3	2	0
1-021	320	5	4	4	2
1-022	320	2	2	0	0
1-024	320	5	2	0	0
1-026	320	5	4	4	2
1-027	320	5	3	4	1
1-029	320	5	3	4	2
1-030	320	5	3	3	0
1-031	320	4	3	3	0
1-032	320	5	3	2	2
1-033	320	5	4	3	0
1-034	320	4	4	4	3
1-035	320	5	4	4	2
1-036	320	4	3	3	4
1-037	320	0	2	3	0
1-038	320	2	2	1	0
1-040	320	3	3	3	1
1-041	320	3	3	3	0
1-042	320	2	2	2	0
1-043	320	5	3	3	3
1-044	320	5	3	3	1
1-046	320	5	3	3	2
1-047	320	4	3	2	1
1-048	320	3	0	0	1
1-049	320	5	2	0	0
1-050	320	5	5	4	2
1-051	320	5	4	4	0
1-052	320	3	3	2	0
1-053	320	2	3	2	0
1-054	320	5	3	4	2
1-055	320	4	4	4	1
1-056	320	5	5	4	3
1-057	320	5	5	4	2
1-058	320	5	5	4	4

[Tabla 50]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C	a
1-059	320	2	3	2	0
1-060	320	4	4	3	2
1-062	320	3	2	1	0
1-063	320	5	4	3	0
1-064	320	5	4	3	0
1-065	320	5	3	2	0
1-066	320	5	4	2	2
1-067	320	3	0	0	0
1-068	320	2	3	3	0
1-069	320	5	4	3	0
1-070	320	5	5	5	3
1-071	320	4	5	4	0
1-073	320	4	3	2	3
1-074	320	2	2	0	0
1-075	320	2	0	2	0
1-076	320	5	4	4	3
1-077	320	0	0	2	0
1-078	320	4	4	3	4
1-079	320	4	4	3	4
1-080	320	5	4	4	4
1-082	320	3	2	2	0
1-083	320	2	3	3	0
1-084	320	2	3	2	0
1-085	320	3	4	3	3
1-086	320	5	4	4	5
1-087	320	5		3	0
1-090	320	3	4	2	0
1-091	320	5	5	5	0
1-092	320	5	5	4	3
1-093	320	5	4	3	0
1-094	320	5	5	3	0
1-095	320	5	5	5	1
1-096	320	5	4	4	3
1-100	320	4	3	3	0
1-102	320	3	2	2	2
1-103	320	5	4	4	3
1-104	320	4	3	2	0
1-105	320	5	5	4	0
1-106	320	5	5	4	1
1-107	320	5	4	5	2
1-108	320	5	5	5	0
1-109	320	0	2	0	0
1-110	320	5	4	4	4
1-112	320	3	3	2	0
1-113	320	4	3	2	0
1-114	320	3	2	0	0
1-115	320	5	4	3	0

[Tabla 51]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C	a
1-116	320	5	4	2	0
1-118	320	3	2	0	2
1-119	320	2	1	0	3
1-120	320	5	3	1	3
1-121	320	5	4	4	3
1-122	320	5	5	5	3
1-123	320	5	4	4	1
1-124	320	3	3	1	0
1-125	320	0	3	1	0
1-126	320	3	4	2	0
1-128	288	5	4	2	0
1-129	320	5	4	3	1
1-130	320	1	0	0	1
1-131	320	2	1	0	0
1-132	320	5	4	4	2
1-133	320	5	3	4	0
1-134	320	3	3	2	0
1-135	320	3	4	4	1
1-136	320	5	3	3	1
1-137	320	5	5	5	3
1-138	320	5	5	4	2
1-139	320	5	4	3	2
1-143	320	0	0	2	0
1-144	320	5	3	3	1
1-145	320	5	5	5	4
1-146	320	5	5	5	3
1-147	320	5	5	5	2
1-148	320	5	5	5	4
1-149	320	5	4	3	3
1-150	320	5	5	5	4
1-151	320	5	5	3	0
1-152	320	5	4	3	2
1-153	320	3	3	4	2
1-154	320		3	2	0
1-155	320		4	3	0
1-156	320		2	0	0
1-157	320		3	2	2
1-158	320		4	0	0
1-159	320		3	0	0
1-161	320		2	0	0
1-162	320		2	0	0
1-163	320		4	4	2
1-164	320		5	4	3
1-165	320	4	3	4	0
1-166	320		3	2	0
1-167	320	4	2	0	0
1-169	320	5	4	4	0

[Tabla 52]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C	a
1-171	320	5	4	4	1
1-172	320	5	4	3	1
2-001	320	2	3	4	0
2-002	320	2	3	3	0
2-003	320	5	5	5	4
2-005	320	5	5	5	0
2-006	320	5	5	5	4
2-007	320	5	5	5	3
2-008	320	4	4	4	1
2-009	320	3	3	4	0
2-010	320	5	5	4	4
2-011	320	5	5	5	2
2-012	320	5	4	3	1
2-013	320	5	4	5	3
2-014	320	5	5	5	4
2-015	320	5	5	5	1
2-016	320	5	5	5	4
2-017	320	5	3	4	4
2-019	320	5	5	4	2
2-020	320	3	2	2	1
2-021	320	5	5	5	4
2-022	320	5	5	5	5
2-023	320	2	1	0	3
2-024	320	5	5	5	5
2-025	320	5	5	5	5
2-026	320	5	5	4	4
2-027	320	5	5	5	4
2-028	320	5	5	5	5
2-029	320	5	5	5	5
2-030	320	5	4	4	3
2-031	320	5	5	5	5
2-032	320	5	5	5	5
2-033	320	5	4	5	4
2-034	320	5	4	4	4
2-035	320	4	3	3	4
2-037	320	5	5	5	4
2-038	320	5	5	5	4
2-039	320	5	5	5	4
2-040	320	4	4	4	4
2-041	320	5	5	4	0
2-042	320	5	4	4	5
2-043	320	5	5	5	4
2-044	320	5	5	5	4
2-045	320	5	5	5	5
2-046	320	4	0	0	0
2-047	320	5	4	5	4
2-048	320	5	5	4	4

[Tabla 53]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C	a
2-049	320	5	5	4	3
2-050	192	4	2	3	2
2-051	320	5	5	5	4
2-052	320	5	5	5	5
2-053	320	5	5	4	5
2-054	320	5	5	5	5
2-056	320	4	4	3	1
2-057	320	4	4	4	4
2-058	320	4	4	5	5
2-059	320	4	4	4	5
2-060	320	5	5	5	5
2-061	320	5	5	5	4
2-062	320	5	5	5	5
2-063	320	5		5	4
2-064	320	5		2	3
2-065	320	5	4	4	2
2-066	320	5	5	4	3
2-067	320	5	4	4	5
2-068	320	5	5	4	5
2-069	320	5	5	5	5
2-070	320	5	5	5	4
2-071	320	5	5	5	4
2-072	320	5	5	5	3
2-073	320	4	3	4	2
2-074	320	4	4	3	3
2-075	320	5	5	5	5
2-076	320	5	4	3	2
2-077	320	5	3	3	1
2-078	320	5	4	2	4
2-079	320	5	5	5	4
2-080	320	3	0	0	2
2-081	320	4	3	4	3
2-082	320	5	5	5	5
2-083	320	5	5	4	2
2-084	320	5	5	4	4
2-085	320	5	5	4	1
2-086	320	3	2	3	0
2-087	320	5	5	4	3
2-088	141	5	5	5	3
2-089	320	5	5	5	4
2-090	320	5	5	5	4
2-091	320	5	5	5	0
2-093	320	5	5	4	2
2-094	320	5	5	5	4
2-095	320	5	5	5	5
2-096	320		5	4	3
2-097	320		4	3	1

[Tabla 54]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C	a
2-098	320		5	4	2
2-099	320	5	4	5	4
2-100	320	5	5	5	3
2-101	320	5	5	5	3
2-102	320	5	5	4	1
2-103	320	5	4	5	3
2-105	320	5	5	5	4
2-106	320	5	3	4	2
2-107	320	2	3	2	1
2-108	320	4	3	2	0
2-109	260	2	3		0
2-110	320	5	5	5	4
4-003	320		2	0	0
6-002	320	4	3	2	0
6-004	320	0	0	2	0
7-001	320	0	2	4	0
7-002	320	3	3	4	1

[0290] [Decimoctava Tabla]

[Tabla 55]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C
1-001	320	4	4	2
1-002	320	3	0	0
1-004	320	4	3	4
1-005	320	5	1	0
1-010	320	4	1	4
1-011	320	5	3	3
1-012	320	2	2	2
1-014	280	2	3	0
1-015	320	4	2	1
1-016	320	3	0	0
1-017	320	2	2	0
1-018	320	0	2	0
1-019	320	4	3	3
1-020	320	2	2	2
1-021	320	4	4	3
1-022	320	2	2	0
1-024	320	4	1	0
1-026	320	3	1	0
1-027	320	4	3	3
1-029	320	3	2	3
1-030	320	4	3	3
1-031	320	3	2	2
1-032	320	4	3	3
1-033	320	4	4	3
1-034	320	4	3	4
1-035	320	5	4	4
1-036	320	3	2	4
1-037	320	2	2	
1-038	320	1	1	0
1-040	320	3	2	
1-041	320	2	3	
1-042	320	1	2	3
1-043	320	3	3	3
1-044	320	2	3	2
1-046	320	4		
1-047	320	3	2	3
1-048	320	0	1	0
1-049	320	4	2	2
1-050	320	5	4	3
1-051	320	4	3	4
1-052	320	1	1	0
1-053	320	1	2	0
1-054	320	4	3	3
1-055	320	3	3	3
1-056	320	5	4	4
1-057	320	2	3	3
1-058	320	4	5	4

[Tabla 56]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C
1-059	320	2	3	2
1-060	320	2	3	2
1-061	320	0	1	1
1-062	320	2	2	2
1-063	320	4	3	2
1-064	320	2	3	2
1-065	320	1	2	2
1-066	320	2	3	2
1-068	320	2	2	2
1-069	320	4	4	4
1-070	320	5	5	5
1-071	320	3	5	4
1-073	320	2	2	1
1-074	320	2	0	0
1-076	320	2	0	4
1-078	320	4	3	3
1-079	320	4	3	4
1-080	320	5	3	4
1-083	320	2	2	2
1-084	320	2	1	0
1-085	320	3	2	2
1-086	320	4	4	4
1-087	320	4		3
1-090	320	2	1	3
1-091	320	5	5	5
1-092	320	4	4	3
1-093	320	3	3	3
1-094	320	4	3	3
1-095	320	4	5	4
1-096	320	4	3	4
1-100	320	4	3	4
1-102	320	1	1	1
1-103	320	4	5	4
1-104	320	4	3	3
1-105	320	3	4	3
1-106	320	5	5	4
1-107	320	5	4	4
1-108	320	4	4	3
1-109	320	0	1	0
1-110	320	4	3	4
1-112	320	1	2	0
1-113	320	2	0	0
1-114	320	0	1	0
1-115	320	3	3	
1-116	320	3	4	0
1-118	320	2	3	0
1-119	320	4	1	0

[Tabla 57]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C
1-120	320	3	3	2
1-121	320	4	4	4
1-122	320	4	3	3
1-123	320	3	2	3
1-124	320	3	3	1
1-125	320	0	2	1
1-126	320	1	3	3
1-128	288	1	3	0
1-129	320	3	4	3
1-131	320	0	1	0
1-132	320	4	4	4
1-133	320	2	2	3
1-134	320	1	3	3
1-135	320	2	2	3
1-136	320	0	2	2
1-137	320	3	3	3
1-138	320	3	3	3
1-139	320	4	3	3
1-144	320	4	4	3
1-145	320	4	4	4
1-146	320	3	3	3
1-147	320	4	2	3
1-148	320	5	5	4
1-149	320	3	3	2
1-150	320	5	5	4
1-151	320	4	4	2
1-152	320	3	3	3
1-153	320	3	3	3
1-154	320	0	2	0
1-155	320	1	2	0
1-156	320	0	3	2
1-157	320	0	1	0
1-158	320	2	3	0
1-159	320	3		
1-162	320	3	1	0
1-163	320	4		
1-164	320	4	4	4
1-165	320	2	2	
1-166	320	2	3	
1-168	320	2	2	
1-169	320	3	4	4
1-171	320	4		
1-172	320	3	4	3
1-173	320	3	2	2
2-001	320	2	2	3
2-002	320	2	1	2
2-003	320	5	3	4

[Tabla 58]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C
2-005	320	5	3	4
2-006	320	5	5	5
2-007	320	4	4	4
2-008	320	3	2	3
2-009	320	3	2	3
2-010	320	5	4	4
2-011	320	4	3	4
2-012	320	4	5	5
2-013	320	5	3	2
2-014	320	5	5	5
2-015	320	4	5	4
2-016	320	5	5	5
2-017	320	5	4	4
2-019	320	4	3	4
2-020	320	2	2	0
2-021	320	5	4	4
2-022	320	5	5	4
2-023	320	0	1	1
2-024	320	5	4	4
2-025	320	5	4	5
2-026	320	5	5	4
2-027	320	5	4	4
2-028	320	5	4	4
2-029	320	5	4	4
2-030	320	4	3	4
2-031	320	5	4	4
2-032	320	5	5	5
2-033	320	4	3	4
2-034	320	5	4	4
2-035	320	2	2	3
2-037	320	5	5	5
2-038	320	5	4	5
2-039	320	5	5	5
2-040	320	4	3	4
2-041	320	5	4	3
2-042	320	4	3	4
2-043	320	5	4	4
2-044	320	5	4	4
2-045	320	5	3	4
2-047	320	3	5	4
2-048	320	3	4	3
2-049	320	5	5	4
2-050	192	1	0	2
2-051	320	5	5	5
2-052	320	5	4	4
2-053	320	5	4	4
2-054	320	5	4	5

[Tabla 59]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C
2-056	320	3	3	3
2-057	320	4	4	4
2-058	320	4	4	4
2-059	320	4	3	4
2-060	320	5	3	5
2-061	320	4	5	5
2-062	320	5	4	5
2-060	320	5	4	5
2-061	320	4	5	5
2-062	320	5	4	5
2-063	320	5	4	5
2-064	320	3	4	3
2-065	320	5	4	4
2-066	320	3		3
2-067	320	5	4	5
2-068	320	5	5	4
2-069	320	5	5	5
2-070	320	5	5	5
2-071	320	3	5	5
2-072	320	5	5	5
2-073	320	2	2	3
2-074	320	4	4	3
2-075	320	5	5	5
2-076	320	2	3	2
2-077	320	2	2	2
2-078	320	4	4	3
2-079	320	5	5	5
2-080	320	2	1	0
2-081	320	2	2	2
2-082	320	5	4	3
2-083	320	3	3	3
2-084	320	4	4	3
2-085	320	4	4	3
2-086	320	0	2	1
2-087	320	4	4	3
2-088	141	4	3	4
2-089	320	4	4	5
2-090	320	5	5	4
2-091	320	4	5	4
2-093	320	2	4	3
2-094	320	5	5	4
2-095	320	4	5	5
2-096	320	3	3	3
2-097	320	0	2	2
2-098	320	5	4	3
2-099	320	5	5	4
2-100	320	4	3	4

[Tabla 60]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C
2-101	320	4	4	5
2-102	320	4	4	4
2-103	320	4	3	4
2-105	320	4	4	4
2-106	320	1	2	3
2-107	320	2	1	2
2-108	320	0	1	
2-109	260	1	1	
2-110	320	5	5	4
6-002	320	3	2	3
6-004	320	3	0	2
7-002	320	4	2	2

[0291] [Decimonovena Tabla]

[Tabla 61]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	H	D	E	b
1-001	320	5	5	4	0
1-002	400	4	4		0
1-004	400	4	5	5	0
1-005	400	2	5	5	0
1-008	320	3	0		0
1-010	400	5	5	4	0
1-011	400	5	5	5	0
1-012	400	3	5		0
1-013	320	3	4	3	0
1-014	320	5	2	4	1
1-015	320	5	5	4	1
1-016	320	5	5	5	1
1-017	320	4	3	4	0
1-018	320	4	4	4	2
1-019	320	5	5	5	4
1-020	320	5	4	4	2
1-021	320	5	5	5	3
1-022	320	5	5	4	2
1-024	320	5	4	4	2
1-025	320	4	3	2	2
1-026	320	5	4	4	4
1-027	320	5	5	5	3
1-029	320	4	5	4	4
1-030	320	5	5	5	4
1-031	320	5	4	3	2
1-032	320	5	5	5	2
1-033	320	5	5	5	1
1-034	320	5	5	5	5
1-035	320	5	5	5	4
1-036	320	5	5	5	4
1-037	320	5	5	5	2
1-038	320	5	5	4	2
1-039	320	3	3	3	2
1-040	320	4	5	4	3
1-041	320	4	5	5	2
1-042	320	5		4	1
1-043	320	5	4	5	5
1-044	320	5	4	4	3
1-045	320	1	3	4	0
1-046	320	5	3	3	3
1-047	320	5	5	4	3
1-048	320	5	4	3	0
1-049	320	5	4	4	1
1-050	320	5	5	5	1
1-051	320	4	5	4	0
1-052	320	4	5	5	0
1-053	320	4	4	4	0

[Tabla 62]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	H	D	E	b
1-054	320	5	5	5	3
1-055	320	5	4	5	2
1-056	320	5	5	5	4
1-057	320	5	5	5	3
1-058	320	5	5	5	4
1-059	320	0	3	3	0
1-060	320	5	4	3	2
1-061	320	5	4	3	1
1-062	320	5	4	4	2
1-063	320	5	5	5	2
1-064	320	5	4	4	2
1-065	320	3	1	3	0
1-066	320	1	4	3	0
1-067	320	5	5	5	2
1-068	320	5	5	5	1
1-069	320	5	5	5	1
1-070	320	4	5	5	0
1-071	320	0	3	5	0
1-072	320	2	1	0	0
1-073	320	5	5	5	4
1-074	320	5	4	3	0
1-075	320	5	4	4	1
1-076	320	5	5	5	3
1-077	320	5	4	3	0
1-078	320	5	5	5	5
1-079	320	5	5	5	5
1-080	320	5	5	5	5
1-081	320	2	0	0	0
1-082	320	4	4	4	0
1-083	320	5	5	5	2
1-084	320	5	5	5	2
1-085	320	5	5	5	3
1-086	320	5	5	5	0
1-087	320	5	5	5	1
1-089	224	3	3	2	0
1-090	320	5	5	5	0
1-091	320	5	5	5	0
1-092	320	5	5	5	4
1-093	320	4	5	4	1
1-094	320	5	4	4	1
1-095	320	4	4	4	1
1-096	320	5	5	4	4
1-100	320	5	5	4	0
1-101	320	1	0	0	0
1-102	320	4	5	4	2
1-103	320	5	5	5	4
1-104	320	5	5	4	0

[Tabla 63]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	H	D	E	b
1-105	320	5	5	5	0
1-106	320	5	5	5	3
1-107	320	5	5	5	3
1-108	320	5	5	5	1
1-109	320	5	5	3	2
1-110	320	5	5	5	5
1-112	320	3	2	1	0
1-113	320	4	3	3	0
1-114	320	4	4	2	0
1-115	320	5	4	4	0
1-116	320	4	4	0	0
1-117	320	4	4	2	0
1-118	320	5	5	3	3
1-119	320	5	5	2	3
1-120	320	5	5	5	3
1-121	320	5	5	5	3
1-122	320	5	5	5	3
1-123	320	4	4	4	1
1-124	320	4	4	4	0
1-125	320	5	4	3	1
1-126	320	4	4	4	0
1-127	320	4	4	3	0
1-128	288	4	3	3	0
1-129	320	5	5	4	3
1-130	320	5	4	2	2
1-131	320	4	4	3	2
1-132	320	5	5	4	3
1-133	320	4	2	0	0
1-134	320	5	4	2	2
1-135	320	5	4	2	1
1-136	320	4	4	0	2
1-137	320	5	5	4	3
1-138	320	5	5	4	3
1-139	320	4	5	5	1
1-141	320	4	2	3	1
1-142	320	3	1	0	0
1-143	320	4	2	4	0
1-144	320	5	4	2	
1-145	320	5	5	5	
1-146	320	5	5	4	
1-147	320	5	5	3	
1-148	320	5	5	5	
1-149	320	5	5	5	
1-150	320	5	5	5	
1-151	320	5	4	4	
1-152	320	5	5	4	
1-153	320	5	5	3	

[Tabla 64]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	H	D	E	b
1-154	320	3	2	4	
1-155	320	1	2	5	
1-156	320	3	2	2	
1-157	320	4	3	4	
1-158	320	5	4	4	
1-159	320	5	3	0	
1-162	320	4	4	2	
1-163	320	5	5	4	
1-164	320	5	5	4	
1-165	320	5	4		0
1-166	320	4	3		2
1-167	320	1	2		
1-168	320	4	3		3
1-169	320	5	4		1
1-170	320	2	4		1
1-171	320	4	4		0
1-172	320	5	5		3
1-173	320	5	4		2
1-174	320	2	2		0
2-001	320	4	4	3	1
2-002	320	5	4	2	2
2-003	200	5	5	5	0
2-005	320	5	5	4	2
2-006	320	5	5	5	5
2-007	320	5	5	5	4
2-008	320	4	5	4	0
2-009	320	5	4	3	4
2-010	320	5	5	5	5
2-011	320	5	5	5	5
2-012	320	4	5	5	2
2-013	320	5	5	5	5
2-014	320	5	5	5	5
2-015	320	5	5	5	4
2-016	320	5	5	5	5
2-017	320	5	5	5	5
2-019	320	5	5	5	5
2-020	320	4	4	4	4
2-021	320	5	5	5	5
2-022	320	5	5	5	5
2-023	320	4	1	0	1
2-024	320	5	5	5	5
2-025	320	5	5	5	5
2-026	320	5	5	5	5
2-027	320	5	5	5	5
2-028	320	5	5	5	5
2-029	320	5	5	5	5
2-030	320	4	5	4	5

[Tabla 65]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	H	D	E	b
2-031	320	5	5	5	5
2-032	320	5	5	5	5
2-033	320	5	5	5	5
2-034	320	5	5	5	5
2-035	320	5	5	4	5
2-036	320	4	5	4	1
2-037	320	5	5	5	5
2-038	320	5	5	5	5
2-039	320	5		5	4
2-040	320	4		5	4
2-041	320	5	5	5	3
2-042	320	5	5	5	5
2-043	320	5	5	5	5
2-044	320	5	5	5	5
2-045	320	5	5	5	5
2-046	320	2	3	3	0
2-047	320	4	5	5	3
2-048	320	5	5	5	3
2-049	320	5	5	5	1
2-050	192	4	3	3	0
2-051	320	5	5	5	4
2-052	320	5	5	5	5
2-053	320	5	5	5	5
2-054	320	5	5	5	5
2-055	131	2	0	0	0
2-056	320	4	5	4	4
2-057	320	5	5	5	5
2-058	320	5	5	5	5
2-059	320	5	5	5	5
2-060	320	5	5	5	5
2-061	320	5	5	5	5
2-062	320	5	5	5	5
2-063	320	5	5	5	3
2-064	320	1	4	5	0
2-065	320	5	5	5	3
2-066	320	5	5	5	3
2-067	320	5	5	5	5
2-068	320	5	5	5	5
2-069	320	5	5	5	5
2-070	320	5	5	5	3
2-071	320	4	5	5	3
2-072	320	4	5	5	1
2-073	320	4	3	5	2
2-074	320	5	5	4	5
2-075	320	5	5	5	5
2-076	320	5	4	4	1
2-077	320	2	4	3	0

[Tabla 66]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	H	D	E	b
2-078	320	5	5	3	4
2-079	320	5	5	5	5
2-080	320	4	5	5	3
2-081	320	5	5	5	4
2-082	320	5	5	5	5
2-083	320	4	4	5	0
2-084	320	5	5	5	5
2-085	320	5	5	4	4
2-086	320	5	5	4	3
2-087	320	5	5	5	3
2-088	141	5	5	4	3
2-089	320	4	5	4	2
2-090	320	5	4	5	
2-091	320	5	3	4	
2-092	320	2	3	2	
2-093	320	1	2	5	
2-094	320	5	5	5	
2-095	320	5	5	5	
2-096	320	0	0	5	
2-097	320	2	3	4	
2-098	320	5	5	5	
2-099	320	5	5		4
2-100	320	5	5		3
2-101	320	5	5		4
2-102	320	5	4		1
2-103	320	5	5		1
2-105	320	5	4		5
2-106	320	1	2		0
2-107	320	4	5		4
2-108	320	4	5		4
2-109	260	3	5		2
2-110	320	5	5		3
3-002	320	0	3		0
4-002	320	0	4	0	0
4-003	320	4	3	0	
5-001	320	1	0	0	0
6-002	320	5	5	4	0
6-003	320	1	5	0	0
6-004	320	4	5	2	3
7-001	320	1	2		
7-002	320	4	4	4	0

[0292] [Vigésima Tabla]

[Tabla 67]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
1-001	320	4	3	4	1	1	1	1	3	3	5	4	4	4	0	0	3	1	4	4
1-002	320	4	2	5	3	1	2	1	3	3	5	5	4		0	0	3	1	5	4
1-004	320	5	4	5	2	2	2	3	4	4	5	5	1	4	0	4	4	2	4	3
1-005	320	3	3	4	1	0	0	0	4	3	5	1	0	3	0	1	0	0	0	0
1-008	320	3	1	5	0	0	0	0	0	2	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0
1-010	320	3	3	4	3	2	1	2	5	5	5	5	1	5	0	1	4	1	5	3
1-011	320	5	4	5	1	1	1	2	5	5	5	5	2	5	0	3	4	0	5	3
1-012	320	3	4	4	0	0	1	1	3	3	5	4	2	4	0	1	2	0	3	4
1-013	320	3	1	4	0	1	1	0	3	3	5	4	1	3	0	0	0	1	3	0
1-014	320	3	3	4	1	1	1	0	4	5	5	5	3	4	1	0	3	1	5	2
1-015	320	4	3	5	3	1	1	3	5	5	5	5	3	5	0	1	4	2	5	4
1-016	320	4	2	5	1	1	1	0	5	5	5	5	2	4	0	0	0	0	5	3
1-017	320	3	0	5	0	0	0	0	5	5	5	4	0	4	0	0	3	0	5	3
1-018	320	0	2	1	0	0	0	0	3	4	5	4	0	4	0	0	0	0	1	0
1-019	320	5	4	5	3	2	2	4	4	5	5	5	4	4	2	2	4	3	5	4
1-020	320	4	3	5	1	1	1	1	2	4	5	4	3	3	0	1	0	1	5	3
1-021	320	4	3	4	1	1	1	1	5	5	5	5	3	4	1	0	3	1	5	3
1-022	320	4	3	5	1	1	1	1	5	5	5	4	2	4	0	2	3	1	4	2
1-024	320	4	3	4	1	0	0	1	4	5	5	4	3	4	0	2	4	0	4	4
1-025	320	3	2	4	0	0	0	0	5	3	5	4	3	3	0	0	3	0	5	2
1-026	320	3	3	3	1	1	1	2	3	4	5	5	2	5	0	0	3	1	5	3
1-027	320	5	4	5	2	2	1	3	5	5	5	5	3	5	0	1	5	2	5	4
1-029	320	5	4	5	1	1	1	1	5	5	5	5	0	5	3	1	3	1	5	1
1-030	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	4	3	2	5	3	5	4
1-031	320	4	4	5	2	1	1	1	5	4	5	4	3	4	0	1	3	1	3	3
1-032	320	5	5	5	2	1	1	2	5	5	5	5	2	4	0	0	4	1	5	4
1-033	320	5	5	5	2	1	1	2	5	5	5	5	3	5	0	2	3	1	5	4
1-034	320	5	5	5	3	1	3	3	5	5	5	5	3	5	5	1	4	2	5	4
1-035	320	5	5	5	2	2	2	3	5	5	5	5	2	5	4	3	4	2	5	3
1-036	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	3	3	4	3	5	5
1-037	320	5	4	4	3	2	2	3	5	5	5	4	4	5	0	1	3	3	5	4
1-038	320	5	5	5	3	1	1	2	5	5	5	5	3	5	0	0	4	1	5	4
1-039	320	2	0	4	0	0	0	0	0	1	4	0	0	0	0	0	0	0	2	0
1-040	320	5	4	4	3	3	3	4	5	5	5	5	3	5	0	0	1	3	5	1
1-041	320	5	4	5	3	1	2	4	5	5	5	5	3	4	0	0	2	3	5	0
1-042	320	4	3	5	2	0	0	2	4	4	5	4	3	4	0	1	3	0	5	3
1-043	320	4	3	5	2	1	1	1	5	5	5	4	3	4	4	2	2	0	5	3
1-044	320	4	4	5	1	1	2	4	5	5	5	4	3	5	0	0	3	0	5	4
1-045	320	3	1	2	0	0	0	0	4	4	5	2	2	3	0	0	1	0	3	3
1-046	320	5	5	5	1	0	0	1	5	5	5	4	2	4	1	2	3	0	5	4
1-047	320	4	4	5	1	0	0	1	5	5	5	4	2	4	0	1	3	0	5	4
1-048	320	5	3	5	2	1	1	2	5	4	5	4	3	4	0	0	4	1	5	4
1-049	320	5	4	5	0	2	2	3	5	5	5	4	3	4	0	4	3	1	5	4
1-050	320	5	4	5	3	2	3	3	5	5	5	5	2	5	1	3	4	3	5	5
1-051	320	3	3	4	1	0	1	1	5	3	5	3	2	3	0	0	1	1	3	1
1-052	320	3	1	2	0	1	1	3	4	4	5	2	1	3	0	0	2	0	3	3
1-053	320	3	2	3	1	0	0	0	4	4	5	2	2	4	0	0	3	0	3	1

[Tabla 68]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
1-054	320	5	4	5	3	3	3	3	5	5	5	4	4	5	0	1	3	3	4	4
1-055	320	4	3	4	1	3	2	3	5	5	5	5	2	4	0	0	3	1	5	4
1-056	320	5	5	5	3	2	2	3	5	5	5	5	4	5	4	4	4	1	5	5
1-057	320	4	4	4	3	2	2	2	5	5	5	5	1	5	0	1	3	0	5	3
1-058	320	5	5	5	3	3	3	2	5	5	5	5	2	5	5	4	4	1	5	4
1-059	320	0	0	2	0	0	0	0	4	2	5	2	0	2	0	0	0	0	0	0
1-060	320	5	3	5	3	2	2	1	4	4	5	4	3	5	3	0	4	3	5	4
1-061	320	3	3	4	3	1	1	1	5	5	5	4	4	5	1	1	4	0	4	4
1-062	320	5	3	5	3	1	0	1	5	4	5	4	4	4	3	0	3	2	4	4
1-063	320	5	5	5	2	2	2	3	4	4	5	4	3	5	0	3	4	2	5	3
1-064	320	5	4	5	1	1	1	1	3	4			3	3	0	0	3	0	4	3
1-065	320	4	1	1	1	0	0	0	3	3	5	4	0	3	0	0	3	0	4	2
1-066	320	3	1	4	1	0	0	0	3	1	5	4	1	4	0	0	3	0	4	0
1-067	320	5	4	5	1	0	0	0	4	1	5	4	3	4	2	0	3	0	4	4
1-068	320	5	4	5	1	1	1	1	3	3	5	4	3	4	2	0	3	1	4	4
1-069	320	5	5	5	2	2	2	4	3	3	5		3		0	1	3	1	5	3
1-070	320	4	4	5	1	0	0	0	4	4	5	5	3		0	0	4	0	4	3
1-071	320	1	0	0	0	0	0	0	3	2	5		1	3	0	0	0	0	2	0
1-072	320	0	0	3	0	0	0	0	1	0	4	2	0	1	0	0	0	0	0	0
1-073	320	5	5	5	3	2	3	3	5	5	5	5	2		5	0	4	3	5	3
1-074	320	4	4	5	1	0	0	0		4	5	4	3	3	0	0	3	0	4	3
1-075	320	3	1	3	0	0	0	0	1	2	5	3	0	3	0	0	0	0	1	1
1-076	320	5	5	5	3	3	3	4	4	4	5	5	2	4	0	3	3	3	5	4
1-077	320	4	2	4	0	0	0	0	2	3	5	4	1	3	0	0	3	0	3	3
1-078	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	4			4	4	4	4	5	4
1-079	320	5	5	5	4	2	3		5	5	5	5	4		4	1	5	4	5	5
1-080	320	5	5	5	4	5	4	5	5	5	5		5		4	4	5	5	5	5
1-081	320	0	0	0	0	0	0	0	0	0	4	2		0	0	0	0	0	1	0
1-082	320	4	3	4	0	0	1	1	4	3	5		0	4	0	0	3	0		0
1-083	320	5	5	5	3	0	1	0	5	5	5	4	4	4	1	1	4	1	5	4
1-084	320	5	5	5	3	0	0	0	5	5	5	4	4	5	3	1	4	0	4	4
1-085	320	5	5	5		3	3	3	5	5	5	4	4	5	3	3	4	3	4	4
1-086	320	5	4	5	0	0	0	0	5	4	5	5	1	4	1	1	1	0	5	4
1-087	320	5	5	5	3	3	1	2	5	5	5	4	1	4	0	4	4	2	5	4
1-088	320	0	0	0	0	0	0	0	0	1	2	0	0	0	0	0	0	0	0	0
1-089	224	1	0	3	2	0	0	0	2	1	4	4	0	3	0	0	1	0	3	1
1-090	320	5	3	5	3	1	1	1	3		5	4	1	5	0	1	4	0	5	4
1-091	320	5	5	5	4	2	3	3	5	5	5	5	4	5	0	2	4	3	5	5
1-092	320	5	5	5	2	1	1	1	4	4	5	5	3	5	5	1	4	0	5	3
1-093	320	5	3	5	1	0	1	1	4	4	5	4	1	4	0	4	3	0	5	3
1-094	320	5	4	5	2	1	1	1	4	4	5	5	0	4	0	4	3	1	5	3
1-095	320	5	3	5	1	1	2	1	4	4	5	5	3	5	0	2	3	1	5	3
1-096	320	5	5	5	2	1	2	3	4	5	5	4	4	5	4	4	4	1	5	5
1-100	320	3	1	4	1	0	0	0	3	1	5	3	0	1	0	0	1	0	3	0
1-102	320	3	3	4	0	0	0	0	3	4	5	4	2	4	0	0	1	0	4	2
1-103	320	5	5	5	4	2	3	3	4	5	5	5	4	5	1	2	4	3	5	5
1-104	320	5	5	5	4	1	1	2	4	4	5	5	3	4	0	3	4	2	4	4

[Tabla 69]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
1-105	320	4	1	4	1	1	1	1	3	3	5	4	1	3	0	1	2	1	4	3
1-106	320	5	5	5	4	1	3	3	4	5	5	5	4	5	3	1	3	3	5	4
1-107	320	5	5	5	4	3	3	3	4	5	5	5	4	5	4	1	5	3	5	5
1-108	320	5	5	5	2	1	2	2	4	5	5	5	3	5	1	1	4	1	5	3
1-109	320	4	3	5	1	0	0	0	4	4	5	4	2	4	0	1	3	0	4	4
1-110	320	5	5	5	4	3	3	3	4	5	5	5	4	5	4	4	4	3	5	5
1-112	320	1	0	2	0	0	0	0	3	4	5	4	0	5	0	0	3	0	5	3
1-113	320	1	0	2	0	0	0	0	1	3	5	4	0	3	0	0	0	0	3	0
1-114	320	1	0	3	0	0	0	0	2	3	5	4	1	3	0	0	0	0	4	0
1-115	320	5	5	5	2	2	1	2	3	4	5	4	3	4	0	0	2	2	5	1
1-116	320	5	4	5	3	1	1	1	4	4	5	5	3	4	0	0	3	2	5	4
1-117	320	1	1	4	0	0	0	0	3	3	5	3	1	3	0	0	3	0	3	1
1-118	320	5	5	5	3	1	1	3	4	4	5	4	4	5	4	0	4	1	5	5
1-119	320	5	4	5	3	3	2	3	5	5	5	4	4	5	3	2	4	3	5	5
1-120	320	5	5	5	3	3	3	5	4	5	5	5	5	5	2	0	4	3	5	5
1-121	320	5	4	5	3	3	3	3	4	5	5	5	3	5	2	2	4	3	5	5
1-122	320	5	5	5	2	3	3	4	5	5	5	5	4	5		2	5	2	5	5
1-123	320	4	3	4	1	0	0	0	4	4	5	4	2	3		0	3	0	4	3
1-124	320	5	3	5	2	0	0	1	5	4	5	3	2	2		1	3	0	3	0
1-125	320	4	1	4	1	0	0	0	3	3	5	4	0	0		2	3	1	5	3
1-126	320	4	3	5	0	0	0	1	3	3	5	5	1	4		1	2	0	5	3
1-127	320	1	1	4	0	0	0	0	2	1	5	3	0	1		0	1	0	2	0
1-128	288	5	2	5	0	1	1	1	3	3	5	5	1	5		0	3	1	5	3
1-129	320	4	4	5	2	1	1	1	3	4	5	5	0			2	4	1	5	3
1-130	320	4	4	5	1	1	1	1	3	3	5	3	4	3		0	3	0	5	4
1-131	320	4	3	4	0	0	0	0	3	3	5	3	0	3		0	3	0	3	0
1-132	320	4	3	5	1	1	1	2	4	3	5		2	4		2	3	1	5	4
1-133	320	3	0	4	0	0	0	0	3	3	4	4	1	2		0	3	0	3	0
1-134	320	4	3	5	0	1	1	1	4	3	5	4	3	4		0	3	1	5	4
1-135	320	4	3	4	1	1	1	1	3	3	5	4	0	1		0	3	0	4	0
1-136	320	4	2	4	0	0	0	1	3	2	5	4	0	3		1	3	0	4	0
1-137	320	4	5	5	3	2	2	4	3	4	5	5	3	5		0	4	2	5	5
1-138	320	4	3	5	2	1	1	3	3	4	5	5	2	5		0	3	1	5	4
1-139	320	5	3	5	1	0	1	0	3	4	5	5	2	5		0	3	1	5	4
1-141	320	3	1	4	0	0	0	0	3	3	4	3	1	3		0	1	0	4	4
1-142	320	1	0	3	0	0	0	0	0	1	4	2	1	0		0	0	0	3	0
1-143	320	2	0	4	0	0	0	0	2	2	4	3	2	3		0	1	0	2	3
1-144	320	3	2	5	2	1	1	0	2	4	5	5	3	4	0	0	4	1	5	4
1-145	320	5	4	5	3	1	2	3	3	4	5	5	1	5	3	0	3	2	5	3
1-146	320	5	5	5	4	2	4	4	4	5	5	5	5	5	5	0	5	3	5	5
1-147	320	4	3	4	3	2	3	3	3	4	5	5	3	5	0	0	3	3	5	5
1-148	320	4	3	5	1	1	3	2	3	5	5	5	4	5	3	0	3	0	5	4
1-149	320	4	3	4	1	1	1	2	3	3	5	5	3	5	1	0	3	0	5	5
1-150	320	4	3	5	3	1	3	3	3	5	5	5	4	5	3	0	4	3	5	5
1-151	320	5	3	5	3	1	3	2	3	5	5	5	4	5	0	0	4	3	5	5
1-152	320	4	3	4	2	0	1	1	3	4	5	4	1	3	0	0	3	0	4	1
1-153	320	4	4	5	3	1	1	2	3	4	5	5	4	4	3	0	5	2	5	3

[Tabla 70]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
1-154	320	3	2	3	0	0	0	0	2	2	5	4	0	0	0	0	2	0	4	0
1-155	320	3	1	3	0	0	0	0	3	3	5		0	2	0	0	3	0	5	0
1-156	320	2	1	4	1	1	1	2	3	3	5	4	1	3	0	0	3	1	3	0
1-157	320	3	1	3	1	1	1	1	3	3	5		1	2	0	0	3	1	4	2
1-158	320	5	4	5	3	1	2	3	4	4	5	5	3	4	0	0	4	2	5	3
1-159	320	4	4	5	2	1	2	2	3	3	5	5	2	3	0	0	3	1	4	1
1-160	320	1	0	2	0	0	0	0	3	1	4	3	0	1	0	0	2	0	2	0
1-161	320	3	0	3	0	0	0	0	1	0	4	0	0	1	0	0	1	0	1	0
1-162	320	3	1	4	1	1	1	0	3	4	4	3	2	3	0	0	3	0	3	1
1-163	320	4	3	5	2	1	1	1	4	4	5	4	3	2	0	0	4	1	4	3
1-164	320	5	5	5	3	1	1	3	4	5	5		4		4	0	5	3	5	4
1-165	320	3	1	4	0	0	0	2	3	4	5	4	2	4	0	0	1	0	5	4
1-166	320	5	4	5	1	0	1	1	3	4	5	4	1		0	0	4	0	5	4
1-167	320	0	0	2	1	0	1	1	2	2	5	5	2	4	0	0	1	0	5	0
1-168	320	5	4	5	1	0	1	0	3	3	5	5	1	5	3	0	3	1	5	3
1-169	320	4	3	5	1	1	1	1	3		5	5	1	4	0	1	5	1	5	0
1-170	320	4	3	4	1	0	1	1	3	3	5	4	2	4	0	0	2	0	5	3
1-171	320	3	3	5	0	0	0	1	4	4	5	5	2	3	0	0	3	0	5	3
1-172	320	5	4	5	2	1	1	1	5	5	5	5	4	4	3	0	4	1	5	4
1-173	320	4	3	5	2	1	1	1	5	5	5	5	4	4	3	0	4	1	5	4
1-174	320	0	0	0	0	0	0	0	0	4	5	3	3	3	0	0	0	0	4	0
2-001	320	3	0	4	1	0	1	0	5	5	5	5	4	5	0	0	2	0	5	4
2-002	320	4	3	5	3	1	1	1	5	5	5	5	4	5	2	0	3	1	5	4
2-003	320	5	5	5	3	3	3	5	5	5	5	5	4	5	4	1	4	3	5	5
2-005	320	5	4	5	3	3	2	4	5	5	5	5	4	5	0	1	3	3	5	4
2-006	320	5	5	5	3	2	1	4	5	5	5	5	3	5	5	1	4	3	5	4
2-007	320	5	4	5	3	2	2	4	5	5	5	5	1	5	2	0	3	2	5	4
2-008	320	3	2	4	3	1	2	1	5	5	5	5	3	4	1	0	3	2	5	3
2-009	320	4	3	5	3	1	2	1	5	5	5	5	4	4	2	1	4	1	5	4
2-010	320	4	3	5	4	3	3	2	5	5	5	5	4	5	5	3	4	3	5	5
2-011	320	5	3	5	3	3	2	3	5	5	5	5	3	5	5	1	4	1	5	1
2-012	320	4	1	4	3	2	2	2	5	5	5	5	4	4	5	3	4	4	5	4
2-013	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	4	5	3	4	4	5	4
2-014	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	4	5	5	3	4	4	5	4
2-015	320	5	4	5	2	2	2	2	5	5	5	4	3	3	4	2	2	2	4	3
2-016	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	3	5	5	1	4	4	5	4
2-017	320	5	5	5	4	3	2	4	5	5	5	5	1	5	5	1	4	3	5	4
2-018	320	2	1	1	0	0	0	0	3	3	3	0	1	2	0	0	0	0	1	0
2-019	320	5	5	5	3	2	2	4	5	5	5	5	3	5	4	0	4	3	5	4
2-020	320	3	3	3	1	0	1	1	5	4	5	4	2	4	2	0	3	1	5	3
2-021	320	5	5	5	3	3	3	4	5	5	5	5	4	5	4	0	4	3	5	4
2-022	320	4	5	5	4	3	3	5	5	5	5	5	4	5	5	1	5	3	5	5
2-023	320	1	1	4	0	0	0	0	3	5	4	3		4	0	0	1	0	4	1
2-024	320	5	5	5	4	3	4	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5	4	5	5
2-025	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	5	1	4	3	5	4
2-026	320	5	4	5	3	4	3	3	5	5	5	5	4	5	5	2	5	3	5	5
2-027	320	5	5	5	3	4	3	4	5	5	5	5	4	5	4	0	1	3	5	4

[Tabla 71]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
2-028	320	5	5	5	4	4	4	5	5	5	5	5	4	5	5	3	4	4	5	5
2-029	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	5	5	5	5
2-030	320	5	5	5	4	3	3	5	5	5	5	5	3	5	5	0	4	3	5	5
2-031	320	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2-032	320	5	5	5	5	3	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2-033	320	5	5	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	5
2-034	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5
2-035	320	5	5	5	4	3	4	4	5	5	5	5	2	5	5	2	4	4	5	5
2-036	320	5	4	5	1	0	0	3	5	5	5	5	4	4	0	0	2	0	5	3
2-037	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
2-038	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2-039	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	4	3	4	3	5	5
2-040	320	5	3	5	3	1	1	3	5	5	5	5	4	5	4	1	4	2	5	3
2-041	320	4	3	5	3	3	3	4	5	4	5	5	4	4	2	0	4	3	5	4
2-042	320	5	5	5	2	2	1	0	5	5	5	3	1	5	4	0	3	0	4	2
2-043	320	5	4	5	4	3	2	4	5	5	5	5	4	5	3	1	4	3	5	4
2-044	320	5	4	5	2	2	2	3	5	5	5	4	3	5	3	2	4	1	5	3
2-045	320	5	4	5	2	1	1	3	5	5	5	5	3	5	4	3	4	1	5	5
2-046	320	0	1	3	0	0	0	0	4	4	4	2	1	1	0	0	0	0	2	0
2-047	320	5	3	5	3	1	1	3	5	5	5	4	3	5	3	0	3	3	5	3
2-048	320	5	5	5	4	3	4	4	5	5	5	4	4		4	4	5	4	5	5
2-049	320	5	5	5	3	1	3	4	4	3	5		3	4	2	1	4	0	4	3
2-050	192	3	1	3	2	0	0	0	3	2	5	3	0	3	0	0	3	0	3	0
2-051	320	5	5	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	4	2	4	4	5	4
2-052	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5			5	4	5	5	5	5
2-053	320	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5		5	4	5	5	5	5
2-054	320	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	4		5	5	5	5	5	5
2-055	131	0	0	0	0	0	0	0	4	3	5	4	0		0	0	1	0	1	0
2-056	320	5	3	4	1	1	1	1	4	4	5	5	4		0	1	3	1	5	3
2-057	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	4	5	4	2	5	4	5	5
2-058	320	5	5	5	5	4	4	4	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5
2-059	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	5	5	5	3	5	4	5	5
2-060	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	5	2	4	4	5	5
2-061	320	5	5	5	4	3	4	3	4	5	5	5	3	5	5	3	4	3	5	4
2-062	320	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5
2-063	320	5	5	5	4	3	3	3	5	5	5	5	4	5	4	3	4	3	5	4
2-064	320	3	2	3	0	0	0	0	5	5	5	5	1	5	0	0	3	0	4	3
2-065	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	3	5	3	4	4	3	5	4
2-066	320	5	5	5	2	3	3	3	4	5	5	5	3	5	4	1	4	3	5	4
2-067	320	5	5	5	5	4	4	3	5	5	5	5	4	5	5	4	5	4	5	5
2-068	320	5	5	5	3	2	2	3	5	5	5	5	4	5	5	3	4	2	5	4
2-069	320	5	5	5	5	3	3	4	5	5	5	5	4	5	5	4	4	3	5	5
2-070	320	5	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	4	5	3	4	3	4	5	5
2-071	320	5	4	5	2	1	1	1	4	5	5	5	3	5	1	2	3	1	5	4
2-072	320	5	5	5	1	1	1	3	5	5	5	5	3	5	1	3	4	1	5	4
2-073	320	1	1	4	1	0	1	0	3	3	5	4	0	2	0	0	2	0	3	0
2-074	320	5	4	5	4	3	3	3	4	5	5	4	3	5	5	3	4	3	5	4

[Tabla 72]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
2-075	320	5	5	5	5	4	4	4	5	5	5	5	4	5	5	3	5	4	5	5
2-076	320	3	3	5	1	1	1	2	4	5	5	5	3	5	1	0	1	0	5	4
2-077	320	4	2	4	0	0	0	0	4	5	5	4	3	3	0	0	2	0	5	2
2-078	320	5	5	5	3	4	4	5	5	5	5	5	4	5	4	1	4	2	5	5
2-079	320	5	5	5	3	4	2	5	5	5	5	5	4	5	5	2	4	2	5	5
2-080	320	5	3	5	1	1	0	3	5	5	5	4	4	5	3	0	4	0	5	5
2-081	320	4	3	5	3	1	1	1	4	5	5	5	3	4		0	3	2	5	4
2-082	320	5	5	5	2	4	4	4	5	5	5	5	4	4		1	5	4	5	5
2-083	320	5	4	5	2	1	1	1	5	5	5	4	3	4		0	4	0	5	1
2-084	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	3		1	3	3	5	3
2-085	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	4		2	5	3	5	4
2-086	320	5	5	5	3	1	2	4	5	5	5	4	4	5		0	4	2	5	3
2-087	320	5	4	5	4	3	3	4	5	4	5	5	3			0	3	2	5	3
2-088	141	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	3	4		0	4	0	5	5
2-089	320	4	4	4	1	2	1	4	4	4	5	5	3	5		0	4	0	5	4
2-090	320	5	4	5	4	3	4	4	3	4		5	4	3	3	1	3	3	5	4
2-091	320	5	5	5	3	2	3	3	4	4	5	5	4	4	2	0	3	3	5	5
2-092	320	0	0	2	1	0	0	0	1	1	3	3	1	1	0	0	1	0	3	0
2-093	320	1	0	1	1	1	1	1	3	2	5	5	2	2	0	0	3	1	2	1
2-094	320	4	4	5	2	1	1	3	5	4	5	5	3	4	3	1	4	1	5	4
2-095	320	5	5	5	4	4	3	5	5	5	5	5	4	4	5	1	5	3	5	5
2-096	320	5	4	5	1	0	0	0	5	5	5	4	3	3	0	0	3	0	5	0
2-097	320	4	3	5	2	1	1	2	3	3	5	4	3	4	0	0	3	0	4	1
2-098	320	5	5	5	4	2	3	4	4	5	5	5	4	4	4	1	4	3	5	4
2-099	320	5	4	5	2	0	1	1	4	4	5	5	4	5	3	0	4	0	5	4
2-100	320	5	4	5	3	2	3	4	5	5	5	5	5	5	5	0	4	0	5	5
2-101	320	5	5	5	3	3	3	4	5	5	5	5	4	5	4	2	5	3	5	5
2-102	320	5	4	5	1	0	1	3	5	5	5	5	3	5	1	0	4	1	5	3
2-103	320	4	3	5	1	0	1	2	4	5	5	5	4	4	2	0	4	0	5	3
2-105	320	5	4	5	4	3	3	4	5	5	5	5	3	5	4	0	4	3	5	5
2-106	320	3	1	3	1	0	0	0	5	4	5	4	3	3	0	0	4	0	5	3
2-107	320	5	3	5	1	0	0	0	5	5	5	5	4	5	3	0	5	0	5	4
2-108	320	4	3	5	1	0	0	0	5	5	5	5	4	5	4	0	4	1	5	5
2-109	256	3	2	4	1	0	1	0	5	5	5	5	3	5	1	0	4	1	5	4
2-110	320	5	4	5	3	2	3	3	5	5	5	5	5	5	4	0	4	3	5	4
3-002	320	0	0	0	0	0	0	0	1	3	4	1	0	0	0	0	0	0	0	0
4-001	320	1	2	3	1	0	0	0	5	5	5	3	3	3	0	0	2	0	2	0
4-002	320	1	1	2	1	0	0	0	5	4	4	3	1	1	0	0	1	0	0	0
4-003	320	2	1	4	0	0	0	1	4	2	5	4	1	2	0	0	4	0	4	1
4-004	320	0	0	0	0	0	0	0	0	0	4	0	0	0	0	0	0	0	0	0
6-001	320	1	2	1	0	0	0	0	3	3	4	4	2	2	0	0	0	0	3	0
6-002	320	4	3	5	1	0	0	0	5	5	5	5	3	4	0	0	3	0	3	3
6-003	320	4	3	3	0	0	0	0	4	2	3	4	1	1	0	0	0	0	1	0
6-004	320	5	4	5	3	1	2	1	5	5	5	4	4	3	0	0	4	1	2	3
6-005	320	3	1	3	0	1	1	1	4	3	3	1	1	1	0	0	0	0	1	0
6-006	320	0	0	0	0	0	0	0	1	0	3	1	0	1	0	0	0	0	0	0
6-007	320	0	0	0	0	0	0	0	2	3	3	0	0	0	0	0	2	0	3	0

[Tabla 73]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
6-008	320	0	0	0	0	0	0	0	1	0	3	1	0	0	0	0	1	0	1	0
7-001	320	0	0	1	0	0	0	0	1	0	2	1	0	0	0	0	0	0	0	0
7-002	320	3	2	4	1	0	0	0	3	4	5	4	3	3	0	0	2	0	4	3

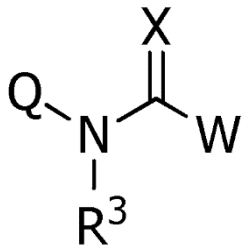
APLICABILIDAD INDUSTRIAL

[0293]

El compuesto de amida heterocíclica de la presente invención es un compuesto nuevo y es útil como herbicida selectivo para *Oryza sative*, *Zea mays*, *Glycine max*, *Triticum aestivum*, *Beta vulgaris ssp. vulgaris*, Y *Brassica campestris L*.

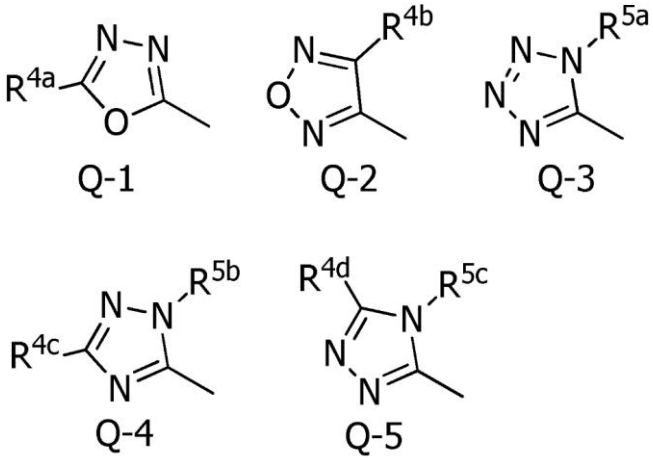
REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de amida heterocíclica de Formula (I):



(1)

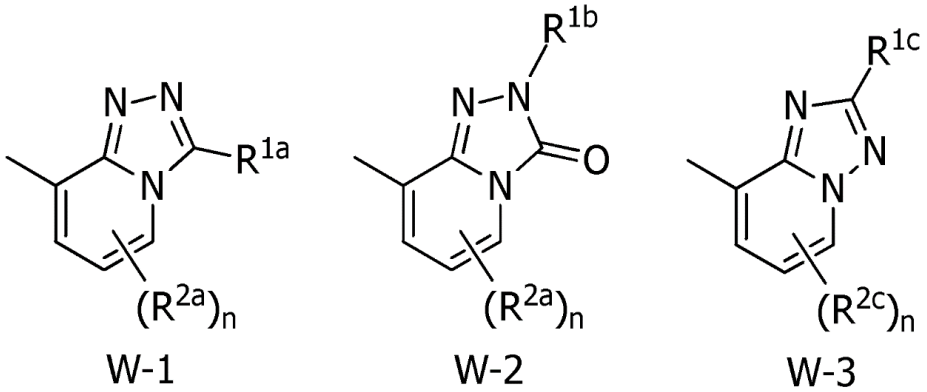
[Donde Q es un heterociclo aromático de cualquiera de Q1 a Q5;



Q-1 Q-2 Q-3

Q-4 Q-5

W es un heterociclo aromático de W-1, W-2 o W-3;



W-1 W-2 W-3

X es un átomo de oxigeno o de azufre;

R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquiloC_{3-6}, (cicloalquiloC_{3-6}) opcionalmente sustituido con

R^6, alqueniloC_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, cicloalqueniloC_{3-6}, - C(O)R^8, -C(O)OR^{16}, ciano, -OR^9, -S(O)$_{m1}$ R^{10}, -N(R^{11})R^{12}, -C(=N^{12b})R^{8b}, fenilo, fenilo sustituido con (R^7) $_p$, naftilo o cualquier grupo de U-1 a U-25;

R^{1b} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquiloC_{3-6}, (C_{3-6})cicloalquilo opcionalmente sustituido con R^6, alqueniloC_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, naftilo, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}) ;

R^{1c} es alquiloC1-6;

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, C_{1-6} haloalquilo, - C (O) R^{18}, -C (O) OR^{24}, ciano, nitro, -OR^{19},-S(O) $_{m3}$ R^{20}, R -N (R^{21})R^{22}, fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$; cuando n es un entero de 2 o más, R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes unos de otros, y cuando son dos R^{2a} son adyacentes, las dos adyacentes R^{2a} opcionalmente forman un anillo de 6 miembros con átomos de carbono ligados a cada R^{2a} formando -CH = CH-CH = CH-;

R^{2c} es haloalquiloC_{1-6};

R^3 es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, -C (O) R^{25} o - C (O) OR^{26};

R^{4a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, (cicloalquilo C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^{27}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6}, -NH_2, alquilamina C_{1-6}, di(alquilC_{1-6}) amina, -NHC(O)R^8, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}) ;

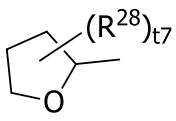
R^{4b} es un átomo de hidrógeno, un halógeno átomo, ciano, nitro, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquilo ($C_{,3-6}$) opcionalmente sustituido con R^{27}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6}, -C (O) OR^{16}, -OR^{38},-S(O)$_{m3}$$R^{20}$, -$NH_2$, alquilamina C_{1-6}, di(alquiloC1-6) amina, - NHC(O)R^8, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros

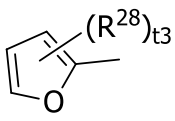
(opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

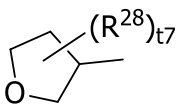
R^{4c} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^{27}, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros, o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

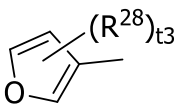
R^{4d} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{35};

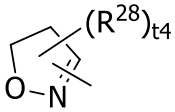
U-1 a U-6, U-6a, U-7 a U-10, U-10, U-11, U-11, U-12, U-12a, U-13, U-13, U-14 U-22, U-22a, U-23, U-24, U-25 y U-26 son heterociclos respectivos de las siguientes estructuras;

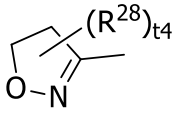

U-1

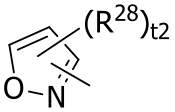

U-2

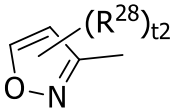

U-3

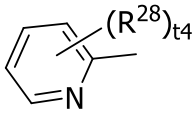

U-4

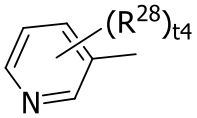

U-5

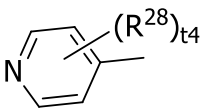

U-5a

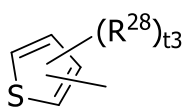

U-6

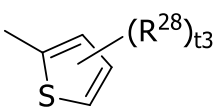

U-6a

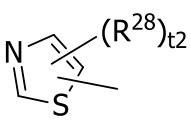

U-7

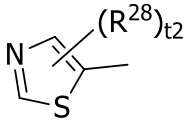

U-8

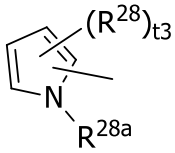

U-9

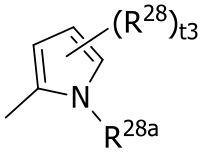

U-10

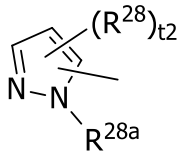

U-10a

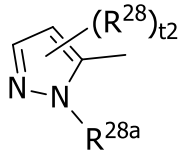

U-11

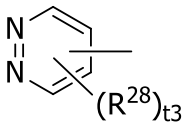

U-11a

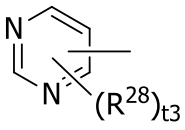

U-12

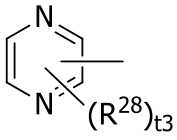

U-12a

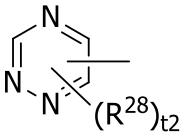

U-13

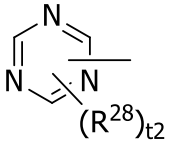

U-13a

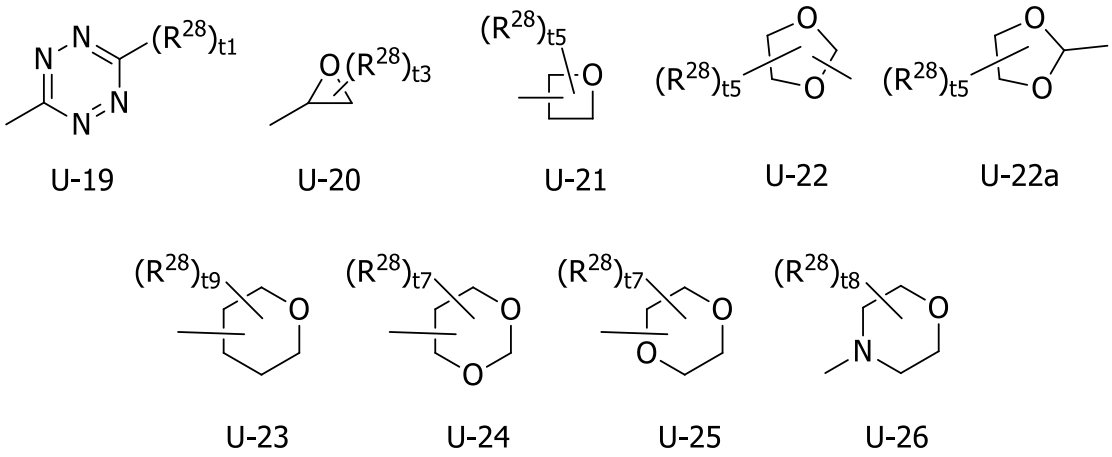

U-14


U-15


U-16


U-17


U-18



R^{5a} y^{5b} de la R son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquiloC_{3-6}, halocicloalquiloC_{3-6}, alqueniloC_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, haloalquiniloC_{2-6}, cicloalqueniloC_{3-6}, fenilo o fenilo sustituido con $(R^{28})_r$;

R^{5c} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{36} o R^{5c} opcionalmente forma un anillo de 6 miembros con un átomo de nitrógeno al que R^{5c} está unido y un átomo de carbono al que R^{4d} se enlaza mediante la formación de -$(CH_2)_4$- o -CH = CH-CH = CH-R^{4d};

R^6 es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquiloC_{3-6}, - C (O) R^8, -C (O) OR^{16}, -OR^{13},-S(O)$_{m2}$ R^{14}, fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$;

R^7 es un halógeno átomo, ciano, nitro, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquiloC_{3-6}, halocicloalquiloC_{3-6}, alqueniloC_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6}, alquilcarbonilo C_{1-6}, cicloalquilcarbonilo C_{3-6}, haloalquilcarbonilo C_{1-6}, halocicloalquilcarbonilo C_{3-6}, alcoxilcarbonilo C_{1-6}, halo alcoxilcarbonilo C_{1-6}, alquilaminocarbonilo C_{1-6}, haloalquilaminocarbonilo C_{1-6}, di(alquilaminoC_{1-6})carbonilo, -OR^{15},-S(O)$_{m3}$$R^{20}$, alquilaminosulfonilo C_{1-6}, di(alquiloC1-6)aminosulfonilo, -NH_2, alquilaminoC_{1-6}, di(alquiloC1-6) amino, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

R^8 es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o -N (R^{11a}) R^{12a};

R^{8b} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^9 es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o fenilo;

R^{10} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6} o haloalquinilo C_{2-6};

R^{11} y R^{12} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquiloC_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, fenilsulfonilo, fenilo, fenilo sustituido $(R^7)_p$, U-7, U-8, U-9 y U-14 y U-19 o R^{11} opcionalmente forma un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al cual R^{11} y R^{12} se adhieren formando una cadena de C_{2-6} alquileno junto con R^{12}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene uno O, S, S(O), $S(O)_2$, o $N(R^{33})$ y es opcionalmente sustituido con un grupo oxo o un grupo tioxo;

R^{11a} y R^{12a} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, o fenilo, o R^{11a} opcionalmente forma un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al cual R^{11a} y R^{12a} están unidos formando una cadena de alquileno C_{2-6} con R^{12a}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene uno O , S, S(O), $S(O)_2$, o N (R^{33}) y es opcionalmente sustituido con un grupo oxo o un grupo de tioxo;

R^{12b} -OR^{19b};

R^{13} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, - C (O) R^8 o fenilo;

R^{14} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6} o fenilo;

R^{15} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6} o cicloalquenilo C_{3-6};

R^{16} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{37};

R^{18} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{19} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o fenilo;

R^{19b} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{20} es alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6} o cicloalquenilo C_{3-6};

R^{21} y^{22} de la R son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, o fenilo, o R^{21} opcionalmente forma un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al cual R^{21} y R^{22} están unidos formando una cadena de C_{2-6} alquileno con R^{22}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene uno O , S, S(O), $S(O)_2$, o N (R^{39}) y está opcionalmente sustituido con un grupo oxo o un grupo de tioxo;

R^{24} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{25} y R^{26} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, haloalquiloC_{1-6}, cicloalquiloC_{3-6}, halocicloalquiloC_{3-6}, alqueniloC_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6} o fenilo;

R^{27} es un átomo de halógeno, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido $(R^{28})_r$, -C (O) OR^{16}, -OR^{29}, -S(O) $_{m4}$ R^{30}, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

R^{28} es un halógeno átomo, ciano, nitro, alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alqueniloC_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, (C_{1-6} alcoxilo) alquiloC1-6, -OR^{31} o -$S(O)_{m4}R^{30}$; cuando t2, t3, t4, t5, t7, t8 o t9 es un entero de 2 o más, las R^{28} opcionalmente son iguales o diferentes entre sí; más cuando dos R^{28} son adyacentes, las dos adyacentes R^{28} opcionalmente forman un anillo de 6 miembros con átomos de carbono para que cada R^{28} se una formando -CH = CH-CH = CH-;

R^{28a} es alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, (alcoxilo C_{1-6}) alquiloC1-6 o alquiloC1-6 (C_{1-6} alquiltio);

R^{29}, R^{30} y R^{31} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6} o fenilo;

R^{33} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C_{3-6}, - C (O) R^8, -C (O) OR^{16}, -OR^{33},-$S(O)_{m6}R^{33}$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-1 U-3, U-7, U-8, U-9 y U-14 a U-25;

R^{35} es un átomo de halógeno o alcoxilo C_{1-6};

R^{35} es un átomo de halógeno o alcoxilo C_{1-6};

R^{36} es un átomo de halógeno o alcoxilo C_{1-6};

R^{37} es alcoxilo C_{1-6},

R^{38} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6} o fenilo;

R^{39} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

T1 es un entero de 0 o 1;

m1, m2, m3, m4, m6 y T2 son cada uno independientemente un número entero de 0, 1 o 2;

n y T3 son cada uno independientemente un número entero de 0, 1, 2 o 3;

p y r son cada uno independientemente un número entero de 1, 2, 3, 4 o 5;

T4 es un entero de 0, 1, 2, 3 o 4;

T5 es un entero de 0, 1, 2, 3, 4 o 5;

T7 es un entero de 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7;

T8 es un entero de 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 y 8; y

T9 es un entero de 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8 o 9] o una sal del mismo.

2. El compuesto de amida heterocíclica o su sal según la reivindicación 1, en donde W es un heterociclo aromático de W-1 o W-2; y

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, - C (O) R^{18}, -C (O) OR^{24}, ciano, nitro, -OR^{19}, o-S(O) $_{m3}$ R^{20}, y cuando n es un entero de 2 o más, las R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes unos de otros.

3. El compuesto de amida heterocíclica o su sal según la reivindicación 2, donde R^{1b} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquilo C_{3-6}, (cicloalquilo C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6, alquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, naftilo o cualquier grupo de U-1 a U-25;

R^{4a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, (cicloalquilo C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^{27}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6}, -NH_2, alquilamino C_{1-6}, di(alquilC_{1-6}) amino, -NHC(O) R^8, fenilo , fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, o cualquier grupo de U-1 a U-26;

R^7 es un átomo de halógeno, ciano, nitro, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquiloC_{3-6}, halocicloalquiloC_{3-6}, alqueniloC_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6},

alquiniloC$_{2-6}$, haloalquinilo C$_{2-6}$, cicloalquenilo C$_{3-6}$, alquilcarbonilo C$_{1-6}$, cicloalquilcarbonilo C$_{3-6}$, haloalquilcarbonilo C$_{1-6}$, halocicloalquilcarbonilo C$_{3-6}$, alcoxilcarbonilo C$_{1-6}$, haloalcoxilcarbonilo C$_{1-6}$, alquilaminocarbonilo C$_{1-6}$, haloalquilaminocarbonilo C$_{1-6}$, di(alquilC$_{1-6}$ amino) carbonilo, -OR^{15},-S(O) $_{m3}$ R^{20}, alquilaminosulfonilo C$_{1-6}$, di(alquiloC1-6) aminosulfonilo, -NH$_2$, alquilamino C$_{1-6}$, di (alquil C$_{1-6}$) amino, o cualquier grupo de U-1 a U-26; y

R^{27} es un átomo de halógeno, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido (R^{28})$_r$, -C (O) OR^{16}, -OR^{29} ,-S(O) $_{m4}$ R^{30}o cualquier grupo de U-1 a U-26.

4. El compuesto de amida heterocíclica o su sal según la reivindicación 3, donde R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquilo C$_{3-6}$, (cicloalquilo C$_{3-6}$) opcionalmente sustituido con R^6, alquenilo C$_{2-6}$, alquinilo C$_{2-6}$, cicloalquenilo C$_{3-6}$, - C (O) R^8, -OR^9,-S(O)$_{m1}$R^{10} , -N (R^{11}) R^{12}, -C (= N^{12b}) R^{8b}, fenilo, fenilo sustituido (R^7)$_p$, U- 3, U-5a, U-6a, U-7, U-8, U-10a, U-11a, U-12a o U-13a;

R^{1b} es alquiloC1-6 o alquiloC1-6 opcionalmente sustituido con R^6;

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, haloalquilo C$_{1-6}$ o -S(O) $_{m3}$ R^{20}, y cuando n es un entero de 2 o más, las R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí;

R^3 es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{4a} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, C$_{3-6}$ cicloalquilo, fenilo, fenilo sustituido con (R^{28})$_r$ o un heterociclo de U-1, U 2, U-7, U-10 y U-26;

R^{4b} es alquiloC1-6;

R$^{4\,c}$ es un átomo de hidrógeno;

R$^{d\,4}$ es alquiloC1-6;

R^{5a} es un átomo de hidrógeno alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, C$_{2-6}$ alquenilo o fenilo;

R^{5b} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R$^{5\,c}$ es alquiloC1-6, o R^{5c} opcionalmente forma un anillo de 6 miembros con un átomo de nitrógeno y que R^{5c} está unido un átomo de carbono a que R^{4d} se enlaza mediante la formación -(CH$_2$)$_4$- o -CH = CH-CH = CH-R^{4d};

R^7 es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, o -OR^{15};

R^{8b} es un átomo de hidrógeno;

R^{9} es alquiloC1-6;

R^{10} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6} o alquinilo C_{2-6};

R^{11} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, fenilsulfonilo, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{7})_{p}$ o U-7;

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{11} opcionalmente forma un anillo de 5-6 miembros junto con un átomo de nitrógeno al cual R^{11} y R^{12} están unidos formando una cadena de C_{4-5} alquileno junto con R^{12}, y en este caso, la cadena de alquileno opcionalmente contiene un O, S, S(O) o $S(O)_2$;

R^{11a} es alquiloC1-6;

R^{12a} es un átomo de hidrógeno;

R^{13} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, - C (O) R^{8} o fenilo;

R^{14} es alquiloC1-6 o (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{15} es alquiloC1-6;

R^{19b} es alquiloC1-6;

R^{20} es alquiloC1-6;

R^{27} es un átomo de halógeno, fenilo, fenilo sustituido $(R^{28})_{r}$, -OR^{29}, -C (O) OR^{16} o -$S(O)_{m4}R^{30}$;

R^{28} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, o -OR^{31}; cuando t2, t3, t4, t5 y t7 es un entero de 2 o más, las R^{28} opcionalmente son iguales o diferentes entre sí; y más cuando dos R^{28} son adyacentes, las dos adyacentes R^{28} opcionalmente forman un anillo de 6 miembros con átomos de carbono para que cada R^{28} se une formando -CH = CH-CH = CH-;

R^{29} es alquiloC1-6;

R^{30} es alquiloC1-6;

R^{31} es alquiloC1-6;

R^{33} es alquiloC1-6; y

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano, C_{3-6} cicloalquilo, - C (O) R^{8}, -C (O) OR^{16}, -OR^{33},-$S(O)_{m6}R^{33}$, fenilo, fenilo sustituido $(R^{7})_{p}$, U-1, U-8 y U-22a.

5. El compuesto de amida heterocíclica o su sal según la reivindicación 4 en donde Q es un heterociclo aromático de Q-1; y W es un heterociclo aromático de W-1.

6. El compuesto de amida heterocíclica o su sal según la reivindicación 5, en donde X es un átomo de oxígeno;

R^{1a} un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquilo C_{3-6}, (cicloalquilo C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6, alquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6}, $-C(O)R^8$, $-OR^9$, $-S(O)_{m1}R^{10}$, $-N(R^{11})R^{12}$, $-C(=N^{12b})R^{8b}$, fenilo , fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-5a, U-6a, U-7, U-8, U-10a, U-11a, U-12a o U-13a;

R^{2a} es alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6} o $-S(O)_{m3}R^{20}$, cuando n es un entero de 2 o más, los R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí;

R^6 es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquiloC_{3-6}, $-C(O)R^8$, $-C(O)OR^{16}$, $-OR^{13}$,$-S(O)_{m2}R^{14}$ o fenilo sustituido con $(R^7)_p$; y

R^{27} es un halógeno átomo, fenilo, $-OR^{29}$ o $-S(O)_{m4}R^{30}$.

7. El compuesto de amida heterocíclica o su sal según la reivindicación 6, en donde R^{4a} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27} o C_{3-6} cicloalquilo; y

R^{27} es un átomo de halógeno o $-OR^{29}$.

8. El compuesto de amida heterocíclica o su sal según la reivindicación 4, en donde Q es un heterociclo aromático de Q-3; y W es un heterociclo aromático de W-1.

9. El compuesto de amida heterocíclica o su sal según la reivindicación 8, donde R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquiloC_{3-6}, (cicloalquiloC_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6, alquenilo C_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, $-C(O)R^8$, $-S(O)_{m1}R^{10}$, $-N(R^{11})R^{12}$, fenilo, fenilo sustituido $(R^7)_p$, U- 3, U-5a, U-6a, U-8, U-10a o U-13a;

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, o haloalquiloC_{1-6} y cuando n es un entero de 2 o más, R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí;

R^6 es un átomo de halógeno, - C (O) OR^{16}, $-OR^{13}$, $-S(O)_{m2}R^{14}$o fenilo sustituido con $(R^7)_p$;

R^7 es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, o $-OR^{15}$;

R^8 es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{11} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$;

R^{11} opcionalmente forma un anillo de 6 miembros con un átomo de nitrógeno al cual R^{11} y R^{12} están unidos formando una cadena de alquileno C5 junto con R^{12}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene un O, S, S(O) o $S(O)_2$;

R^{16} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{27} es fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, $-OR^{29}$, -C (O) OR^{16} o $-S(O)_{m4}R^{30}$;

R^{28} es un átomo de halógeno o alquiloC1-6; y

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C_{3-6}, $-OR^{33}$, $-S(O)_{m6}R^{33}$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-1 y U-8.

10. el compuesto amida heterocíclicos, o la sal misma según la reivindicación 9, en donde R^{5a} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27} o alquenilo C_{2-6}; y

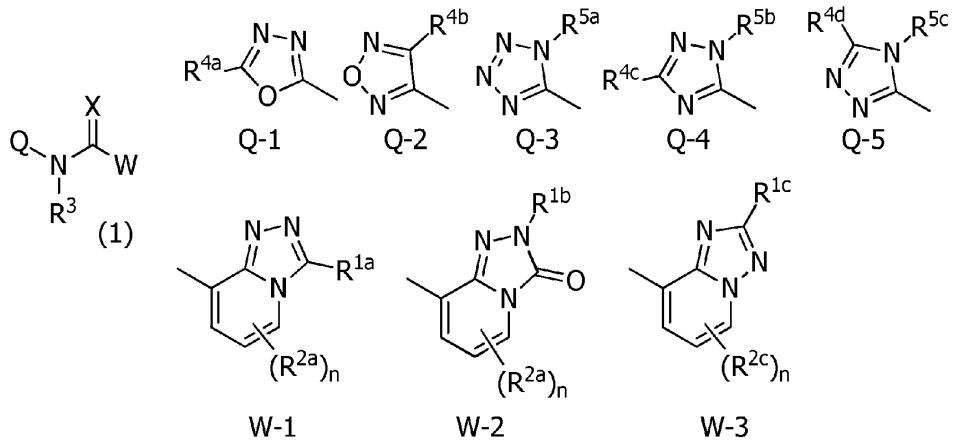
R^{27} es $-OR^{29}$ o $-S(O)_{m4}R^{30}$.

11. Un químico agrícola que comprende uno o dos o más compuestos seleccionados del compuesto de amida heterocíclica y la sal mismo, como en las reivindicaciones 1 o 2, como un componente activo.

12. Un herbicida que comprende uno o dos o más de los compuestos seleccionados del compuesto de amida heterocíclica y la sal mismo, como en las reivindicación 1 o 2, como un componente activo.

RESUMEN

La presente invención proporciona un compuesto de amida heterocíclica de fórmula (1) y un producto químico agrícola, particularmente un herbicida que contiene:



Donde Q es un heterociclo aromático de cualquiera de Q-1 a Q-5;

W es un heterociclo aromático de W-1, W-2 o W-3;

X es un átomo de oxígeno, etc.,

R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, o alquiloC1-6, etc.,

R^{1b} es un átomo de hidrógeno,

$R^{c\,1}$ alquiloC1-6,

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, etc.,

$R^{2\,c}$ es haloalquilo C_{1-6},

R^{3} es un átomo de hidrógeno, etc.,

R^{4a}, R^{4b}, $R^{4\,c}$ y $^{4\,d}$ de R son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6, etc.,

R^{5a}, R^{5b} y $R^{c\,5}$ son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, o alquiloC1-6, etc.,

y n es un entero de 0, 1, 2 o 3.

R^{2a}	R^{1b}
$CF(CH_3)_2$	CH_2Ph
$CF(CH_3)_2$	CH(Me)Ph
CF_2CF_2H	Me
CF_2CF_2H	Et
CF_2CF_2H	Pr-n
CF_2CF_2H	Pr-i
CF_2CF_2H	Pr-c
CF_2CF_2H	Bu-n
CF_2CF_2H	Bu-i
CF_2CF_2H	Bu-c
CF_2CF_2H	Bu-s
CF_2CF_2H	Bu-t
CF_2CF_2H	Pen-n
CF_2CF_2H	Pen-i
CF_2CF_2H	Pen-c
CF_2CF_2H	Pen-s
CF_2CF_2H	Pen-t
CF_2CF_2H	3-Pen
CF_2CF_2H	Hex-n
CF_2CF_2H	Hex-c
CF_2CF_2H	CH_2Ph
CF_2CF_2H	CH(Me)Ph
CF_2CF_2H	$CH_2)_2Ph$
CF_2CF_2H	$CH_2)_3Ph$
CF_2CF_3	Me
CF_2CF_3	Et
CF_2CF_3	Pr-n
CF_2CF_3	Pr-i
CF_2CF_3	Pr-c
CF_2CF_3	Bu-n
CF_2CF_3	Bu-i
CF_2CF_3	Bu-c
CF_2CF_3	Bu-s
CF_2CF_3	Bu-t

R^{2a}	R^{1b}
CF_2CF_3	Pen-n
CF_2CF_3	Pen-i
CF_2CF_3	Pen-c
CF_2CF_3	Pen-s
CF_2CF_3	Pen-t
CF_2CF_3	3-Pen
CF_2CF_3	Hex-n
CF_2CF_3	Hex-c
CF_2CF_3	CH_2Ph
CF_2CF_3	CH(Me)Ph
CF_2CF_3	$CH_2)_2Ph$
CF_2CF_3	$CH_2)_3Ph$
$CF_2CF_2CF_3$	Me
$CF_2CF_2CF_3$	Et
$CF_2CF_2CF_3$	Pr-n
$CF_2CF_2CF_3$	Pr-i
$CF_2CF_2CF_3$	Pr-c
$CF_2CF_2CF_3$	Bu-n
$CF_2CF_2CF_3$	Bu-i
$CF_2CF_2CF_3$	Bu-s
$CF_2CF_2CF_3$	Bu-t
$CF(CF_3)_2$	Me
$CF(CF_3)_2$	Et
$CF(CF_3)_2$	Pr-n
$CF(CF_3)_2$	Pr-i
$CF(CF_3)_2$	Pr-c
$CF(CF_3)_2$	Bu-n
$CF(CF_3)_2$	Bu-i
$CF(CF_3)_2$	Bu-s
$CF(CF_3)_2$	Bu-t

El compuesto de la presente invención puede ser empleado tanto para los métodos de aplicación en el suelo y la aplicación de follaje bajo las inundaciones como un herbicida para arrozales. Ejemplos de malezas de arrozales pueden incluir las malezas de hierbas Potamogetonace *Potamogetonaceae* representados por *Potamogeton distinctus;* malezas de hierbas *Alismatacea* representados por *canaliculatum Alisma, Sagittaria pygmaea* y *Sagittaria trifolia;* malezas *gramíneas* representadas por *Leptochloa chinensis, Echinochloa crus-galli, Echinochloa oryzicola, Homalocenchrus japonocus* y *Paspalum distichum*; malezas de hierbas Cyp*eracea* representados por *Eleocharis kuroguwai, juncoides Scirpus, nipponicus Scirpus, Cyperus serotinus, Cyperus difformis* y *Cyperus hakonensis*; malezas de hierbas *Lemnacea* representados por *Spirodela polyrhiza* y *Lemna paucicostata*; malezas de hierbas *Commelinacea* representados por *Murdannia keisak*; malezas de *hierbas Pontederiacea* representados por *Monochoria korsakowii* y *Monochoria vaginalis*; malezas de hierbas *elatinacea* representados por *Elatine triandra*; malezas *de hierbas Lythracea* representados por *Ammannia multiflora* y *Rotala índica;* las malas hierbas *Oenotheraceae* representados por *Lidwigia epilobioides*; malezas de hierbas Scrophulariace*a* representados por *junceum Dopatrium, Gratiola japonica, Limnophila sessilifolia, Lindernia pyxidaria* y *Lindernia dubia*; malezas de hierbas*leguminosas* como *Aeschynomene indica* y malezas de hierbas *Composita* representados *por, Bidens frondosa* y *Bidens tripartita* y similares.

El compuesto de la presente invención puede ser empleado en cualquier método de tratamiento de suelos, tratamientos de incorporación al suelo y tratamiento de follaje en campos secos y huertas. Ejemplos de maleza de campos secos pueden incluir malezas de hoja ancha tales como maleza de Solanácea que están representadas por las malezas *Solanum nigrum* y *Datura stramonium*; *Geraniaceae* representados por *Granium carolinianum*; Malvaceae representada por las malezas *Abutilon theophrasti* y *Sida spinosa*; Convolvulaceae representadas por las malezas *Ipomoea spps.* tales como *Ipomoea purpurea* y *Calystegia spps.*; Amaranthaceae representadas por las malezas *Amaranthus lividus* y *Amaranthus retroflexus*; Compositae representadas por las malezas *Xanthium pensylvanicum*, *Ambrosia artemisiaefolia*, *Helianthus annuus*, *Galinsoga ciliata*, *Cirsium arvense*, *Senecio vulgaris*, y *Erigeron annuus*; Cruciferae representadadas por las malezas *Rorippa indica*, *Sinapis arvensis*, y *Capsella Bursapastoris*; Polygonaceae representadas por las malezas *Polygonum Blumei* y *Polygonum convolvulus*; *Portulacaceae* representadas por las

malezas *Portulaca oleracea*; *Chenopodiaceae* representadas por las malezaas *Chenopodium album*, *Chenopodium ficifolium*, y *Kochia scoparia*; *Caryophyllaceae* representadas por las malezas *Stellaria media*; *Scrophulariaceae* representadas por las malezas *Veronica persica*; *Commelinaceae* representada por las malezas *Commelina communis*; *Labiatae* representadas por las malezas *Lamium amplexicaule* y *Lamium purpureum*; *Euphorbiaceae* representadas por las malezas *Euphorbia supina* y *Euphorbia maculate*; Rubiaceae representadas por las malezas *Galium spurium* y *Rubia akane*; *Violaceae* weeds represented by *Viola mandshurica*; Leguminosae representadas por las malezas *Sesbania exaltata* y *Cassia obtusifolia*; y *Oxsaldaseae* representado por *Oxsalis courniculata*; Graminaceous representadas por las malezas *Sorgham bicolor*, *Panicum dichotomiflorum*, *Sorghum halepense*, *Echinochloa crus-galli var. crus-galli*, *Echinochloa crus-galli var. praticola*, *Echinochloa utilis*, *Digitaria ciliaris*, *Avena fatua*, *Alopecurus myosuroides*, *Eleusine indica*, *Setaria viridis*, *Setaria faberi*, and *Alopecurus aegualis*; y *Cyperaceous* representadas por las malezas *Cyperus rotundus* y *Cyperus esculentus* y similares.

El compuesto de la presente invención puede ser empleado en cualquier método de tratamiento de suelos, tratamientos de incorporación al suelo y tratamiento de follaje en campos no aptos para cultivo tales como céspedes, terrenos de juego, terrenos abiertos, bermas, y verjas de ferrocarril aparte de los campos agrícolas y hortícolas, como arrozales, campos secos, y huertos. Como malezas de tierras no agrícolas, los siguientes ejemplos de malezas se ejemplifican además de las descritas como las malezas de campos secos y huertos. Ejemplos de malezas pueden incluir *Poa annua, Taraxacum officinale, Conyza sumatrensis, Cardamine flexuosa, Trifolium repens, sibthorpioides Hydrocotyle, Plantago asiatica, Cyperus brevifolius, Kyllinga brevifolia* y *Equisetum arvense* y similares.

Cuando el compuesto de la presente invención se aplica como herbicida, el compuesto generalmente se mezcla con un vehículo sólido o vehículo líquido apropiado, y se añaden agentes tensioactivos, agentes de penetración, agentes de diseminación, espesantes, agentes anticongelantes, aglutinantes, agentes antiaglomerantes, agentes de desintegración, agentes estabilizantes, y similares, si se desea. El herbicida puede aplicarse a usos prácticos por cualquier formulación herbicida de la forma herbicida tales como agentes dispersables en agua, agentes de emulsión, agentes de flujo, agentes de fluidos secos, agentes líquidos, agentes en polvo, agentes de granulado, o agentes de gel. Desde el punto de vista del ahorro de trabajo y mejora de la seguridad, cualquiera de las formulaciones herbicidas de la forma herbicida se puede aplicar en un estado

encapsulado en un paquete soluble en agua.

Ejemplos de los vehículos sólidos pueden incluir los minerales naturales, tales como cuarzo, caolinita, pirofilita, sericita, talco, bentonita, arcilla ácida, atapulgita, zeolita, y tierra de diatomeas; sales inorgánicas tales como carbonato de calcio, sulfato de amonio, sulfato de sodio y cloruro de potasio; y ácido silícico sintético y silicatos sintéticos.

Ejemplos de portadores líquidos pueden incluir alcoholes tales como etilenglicol, propilenglicol, e isopropanol; hidrocarburos aromáticos tales como xileno, alquilbenceno, y alquilnaftaleno; éteres tales como butil cellosolve; cetonas tales como ciclohexanona; ésteres tales como γ butirolactona; amidas de ácido tales como N-metil-pirrolidona y N-octilpirrolidona; aceites vegetales tales como aceite de soja, aceite de colza, aceite de semilla de algodón, y aceite de ricino; y agua.

Estos vehículos sólidos y líquidos pueden utilizarse solos o en combinaciones de dos o más de ellos.

Ejemplos del tensioactivo pueden incluir tensioactivos no iónicos tales como éteres alquílicos de polioxietileno, éteres de alquilaril polioxietileno, éteres de polioxietileno estirilfenil, copolímeros de bloque de polioxietileno-polioxipropileno, ésteres de ácido graso de polioxietileno, ésteres de ácidos grasos de sorbitán, y ésteres de ácidos grasos de polioxietileno sorbitán; tensioactivos aniónicos tales como sulfatos de alquilo, sulfonatos de alquilbenceno, sulfonatos de lignina, sulfosuccinatos de alquilo, sulfonato de naftaleno, sulfonatos de alquilnaftaleno, sales de condensado de formalina de ácido sulfónico naftaleno, sales de formalina condensado de alquilnaftaleno ácido sulfónico, sulfatos y fosfatos de polioxietilen esterilfenil, éter estirilfenílico de polioxietileno sulfatos y fosfatos, policarboxilatos, y sulfonatos de poliestireno; tensioactivos catiónicos tales como sales de alquilamina y sales de amonio cuaternario de alquilo; y tensioactivos anfóteros tales como tensioactivos de tipo amino ácido y tensioactivos de tipo betaína.

El contenido de los tensioactivos no está particularmente limitado. Por lo general, el contenido está preferiblemente dentro de un rango de 0,05 partes en peso a 20 partes en peso con respecto a 100 partes en peso de la formulación herbicida de la presente invención. Estos tensioactivos se pueden utilizar solos o en combinaciones de dos o más de ellos.

El compuesto de la presente invención puede aplicarse en un estado mezclado con otro herbicida, diversos insecticidas, un bactericida, un regulador de crecimiento de plantas, un agente sinérgico, o similares en el momento de la formulación o aplicación de herbicidas.

En particular, mediante la aplicación del herbicida en un estado mixto con otro herbicida, se puede esperar la reducción en el costo por la reducción en una cantidad de aplicación, la expansión en el espectro herbicida por acción sinérgica de herbicidas mixtos, y un efecto herbicida más alto. En este momento, una combinación de una pluralidad de herbicidas conocidos, al mismo tiempo también es posible.

Ejemplos del herbicida preferible utilizado en una mezcla con el compuesto de la presente invención pueden incluir acetoclor / nombre general, acifluorfen / nombre general, aclonifen / nombre general, alaclor / nombre general, aloxidim / nombre general, aloxidim de sodio / nombre general, ametrina / nombre general, amicarbazona / nombre general, amidosulfurón / nombre general, aminociclopiraclor / nombre general, sales y ésteres de aminociclopiraclor, aminopiralid / nombre general, sales y ésteres de aminopiralid, amiprophos-metil / nombre general, amitrol / nombre general, anilofos / nombre general, asulam / nombre general, atrazina / nombre general, azafenidina / nombre general, azimsulfurón / nombre general, beflubutamida / nombre general, benazolin-etil / nombre general, bencarbazona / nombre general, benfluralina (benefina) / nombre general, benfuresato / nombre general, bensulfurón-metil / nombre general, bensulida / nombre general, bentazona / nombre general, bentazona en sodio / nombre general, sales de Bentazona, bentiocarb / nombre general, benzfendizona / nombre general, benzobiciclon / nombre general, benzofenap / nombre general, biciclopirona / nombre general, bifenox / nombre general, bispiribac / nombre general, / nombre general, bispiribac de sodio, bromacil / nombre general, bromobutida / nombre general, bromofenoxim / nombre genérico, bialafos / nombre general, bialafos-sodio, bromoxinil / nombre general, bromoxinil-sales y ésteres, butaclor / nombre general, butafenacil / nombre general, butamifos / nombre general, butenaclor / nombre general, butralina / nombre general, butroxidim / nombre general, butilato / nombre general, cafenstrol / nombre general, carbetamida / nombre general, etilcarfentrazona /no, clometoxifeno / nombre general, chlomethoxynil / nombre general, cloramben / nombre general, cloramben-sales y ésteres, chloransulam-metil / nombre general, clorflurenol-metil / nombre general, cloridazon / nombre general , clorimurón-etil / nombre general, chlorobromuron / nombre general, clorotoluron nombre / nombre general, cloroxurón / nombre general, clorftalim / nombre general, Clorprofam / nombre general, Clorpropham / nombre general, clorosulfurona / nombre general, clortal-dimetil / nombre general, clortiamid / nombre general, cinidón-etilo / nombre general, cinmetilina / nombre general, cinosulfurón / nombre general, cletodim / nombre general, clodinafop / nombre general,

clodinafop-propargilo / nombre general, clomazona / nombre general, clomeprop / nombre general, clopiralid / nombre general, clopiralid-sales y ésteres, / nombre general CNP, cumilurón / nombre general, cyanazin / nombre general, cicloato / nombre general, / nombre general cyclopyrimorate (SW-065 / nombre de la prueba), ciclosulfamurón / nombre general, cicloxidim / nombre general, cihalofopbutilo / nombre general, DAH-500 / nombre de la prueba, dalapon / nombre general, dazomet / nombre general, desmedifam / nombre general, desmetrina / nombre general, dicamba / nombre general, dicamba-sales y ésteres, diclobenil / nombre, diclofop / nombre general en general, diclofop-metil / nombre general, diclorprop / nombre general, diclorprop-sales y ésteres, diclorprop-P / nombre general, sales y ésteres de diclorprop-P-, diclosulam / nombre general, difenzoquat / nombre general , diflufenican / nombre general, diflufenzopir / nombre general, diflufenzopir de sodio / nombre general, dimepiperato / nombre general, dimetametrina / nombre general, dimetaclor / nombre general, dimetenamid / nombre general, dimetenamida-p / nombre general, dimetipin / nombre general, dinitramina / nombre general, dinoseb / nombre general, dinoterb / nombre general, DNOC / nombre general , difenamida / nombre general, diquqt / nombre general, ditiopil / nombre general, diurón / nombre general, DSMA / nombre general, dymron / nombre general, endotal / nombre general, EPTC / nombre general, esprocarb / nombre general, etalfluralina / nombre general, etametsulfurón-metilo / nombre general, etofumesato / nombre general, etobenzanid / nombre general, etoxisulfurón / nombre general, flazasulfurón / nombre general, fenoxaprop / nombre general, fenoxaprop-etilo / nombre general, fenoxasulfona / nombre general, fenquionotrion / nombre general, fentrazamida / nombre general, flamprop / nombre general, flazasulfurón / nombre general, florasulam / nombre general, fluazifop / nombre general, fluazifop-butilo / nombre general, flucetosulfurón / nombre general, flucloralin / nombre general, flufenacet / nombre general, flufenpil-etil / nombre general, flumetsulam / nombre general, fluazolato / nombre general, flucarbazona de sodio /nombre general, flumiclorac-pentilo / nombre general, flumioxacina / nombre general, fluometurón / nombre general, Fluoroglicofen etilo /nombre general, flupirsulfurón / nombre general, flupoxam / nombre general, Flurenol / nombre general, fluridona / nombre general, flurocloridona / nombre general, fluroxipir / nombre general, ésteres de fluroxipir, flurprimidol / nombre general, flurtamona / nombre general, flutiacet-metil / nombre general, fomesafen / nombre general, foramsulfurón / nombre general, fosamina / nombre general, glufosinato / nombre general, glufosinato de amonio / nombre general, glifosato / nombre general, glifosato de amonio / nombre general, glifosato-iso-propilamonio / nombre general,

glifosato de potasio / nombre general, glifosato de sodio / nombre general, glifosato trimesio / nombre general, halauxifen / nombre general, sales y ésteres de halauxifen, halosafeno / nombre general, halosulfurón / nombre general, halosulfurón-metil / nombre general, haloxifop / nombre general, haloxifop-metilo / nombre general, hexazinona / nombre general, imazametabenz-metilo / nombre general, imazamox / nombre general, imazapic / nombre general, imazapir / nombre general , imazetapir / nombre general, imazaquin / nombre general, imazosulfurón / nombre general, indanofan / nombre general, indaziflam / nombre general, yodosulfurón-metilo de sodio / nombre general, ioxinil octanoato / nombre general, sales y ésteres de ioxinil, ipfencarbazona / nombre general, isoproturón / nombre general, isouron / nombre general, isoxaben / nombre general, isoxaflutol / nombre general, carbutilato / nombre general, lactofen / nombre general, lenacilo / nombre general, linurón / nombre general, hidracida maléico / nombre general, MCPA / nombre general, sales y ésteres de MCPA, MCPB / nombre general, sales y ésteres de MCPB-, mecoprop (MCPP) / nombre general, sales y ésteres de mecoprop, mecoprop-P (MCPP-P) / nombre general, sales y ésteres de mecoprop-P, mefenacet / nombre general, mefluidida / nombre general, mesosulfurón-metil / nombre general, mesotriona / nombre general, metam / nombre general, metamifop / nombre general, metamitrona / nombre general, metazaclor / nombre general, metabenztiazurón / nombre general, metazosulfuron / nombre general, methiozolin / nombre general, azida de metilo / nombre general, bromuro de metilo / nombre general, metilo dymron / nombre general, yoduro de metilo / nombre general, metobenzuron / nombre general, metolacloro / nombre general, metolacloro-S / nombre general, metosulam / nombre general, metribuzina / nombre general, metsulfurón-metil / nombre general, metoxurón / nombre general, molinato / nombre general, monolinurón / nombre, monosulfuron / nombre general, monosulfuron-metil / nombre general, MSMA / nombre general, naproanilida / nombre general, napropamida / nombre general, naptalam / nombre general, naptalam de sodio / nombre general, neburón / nombre general, nicosulfurón / nombre general, norflurazon / nombre general, OK-701 / nombre general, ácido oleico / nombre general , orbencarb / nombre general, orthosulfamuron / nombre general, orizalina / nombre general, oxadiargilo / nombre general, oxadiazón / nombre general, oxasulfurón / nombre, oxaziclomefona / nombre general, oxifluorfeno / nombre general, paraquat / nombre general, pelargonicacid / nombre general, pendimetalina / nombre, penoxsulam / nombre general general, pentanoclor / nombre general, pentoxazona / nombre general, petoxamida/ nombre general , fenmedifam-etil / nombre general, picloram / nombre general, sales y ésteres de Picloram,

picolinafeno / nombre general, pinoxaden / nombre general, piperofos / nombre general, pretilaclor / nombre general, primisulfuron-metil / nombre general, prodiamina / nombre general, profluazol / nombre general, profoxidim / nombre general, prometón / nombre general, prometrina / nombre general, propaclor / nombre general , propanil / nombre general, propaquizafop / nombre general, propazin / nombre general, profam / nombre general, propisocloro / nombre general, propoxicarbazona de sodio / nombre general, propirisulfuron / nombre general, propizamida / nombre general, prosulfocarb / nombre general, prosulfurón / nombre general, piraclonil / nombre general, piraflufenetilo / nombre general, pirasulfotol / nombre general, pirazolinato / nombre general, pirazosulfurón / nombre general, pirazosulfurón-etil / nombre general, pirazoxifeno / nombre general, piribenzoxim / nombre general, piributicarb / nombre general, piridafol / nombre general, piridato / nombre general, piriftalid / nombre general, piriminobac-metil / nombre general, pirimisulfan / nombre general, piritiobac de sodio / nombre general, piroxasulfona / nombre general, piroxsulam / nombre general, quinclorac / nombre general, quinmerac / nombre general, quinoclamina / nombre general, quizalofop / nombre general, quizalofop-etilo / nombre general, quizalofop-tefurilo / nombre general, quizalofop-P / nombre general, quizalofop-P-etilo / nombre general, quizalofop-P- tefurilo / nombre general, rimsulfurona / nombre general, Saflufenacil / nombre general, setoxidim / nombre general, siduron / nombre general, simazina / nombre general, simetrina / nombre general, SL-261 / nombre general, sulcotriona / nombre general, sulfentrazona / nombre general, sulfometuron-metil / nombre general, sulfosulfuron / nombre general, TCBA (2,3,6-TBA) / nombre general, sales y ésteres de 2,3,6-TBA, TCTP (clortal-dimetil, tetoraclorotiofeno) / nombre general, tebutam / nombre general, tebutiurón / nombre general, tefuriltriona / nombre general, tembotriona / nombre general, tepraloxidim / nombre general, terbacilo / nombre general, terbumeton / nombre general, terbutilazina / nombre general, terbutrina / nombre general, tetrapion (flupropanato) / nombre general, tenilcloro / nombre general, tiazafluron / nombre general, tiazopir / nombre general / nombre general, tidiazurón / nombre general, tiencarbazona-metil / nombre general, / nombre general, tolpiralato / nombre general, topramezon tifensulfurón-metil / nombre general, tralcoxidim / nombre general, triafamone / nombre general, trialato / nombre general, triasulfurón / nombre general, triaziflam / nombre general, tribenurón-metil / nombre general, triclopir / nombre general, sales y ésteres de triclopir-, tridifano / nombre general, trietazina / nombre general, trifludimoxadin / nombre general, trifloxisulfurón / nombre general, trifluralina / nombre general, triflusulfurón-metil / nombre

general, tritosulfurón / nombre general, 2,4-PA / nombre general, sales y ésteres de 2,4-PA-, 2,4-DB / nombre general y sales y ésteres de 2,4-DB. Estos componentes se pueden utilizar solos o en combinaciones de dos o más de ellos. Cuando estos componentes se mezclan, la proporción de mezcla puede ser libremente seleccionada.

Los ejemplos de agentes de seguridad pueden incluir AD-67, benoxacor / nombre general, cloquintocet-mexilo / nombre general, ciomerinil / nombre general, diclormid / nombre general, diciclonona / nombre general, ciprosulfamida / nombre general, dietorato / nombre general, CAD -24, dimron / nombre general, fenclorazol-etil / nombre general, fenclorim / nombre general, HEXIM / nombre general, flurazol / nombre general, fluxofenim / nombre general, furilazol / nombre general, isoxadifen / nombre general, etil isoxadifen / nombre general, MCPA, mecoprop / nombre general, mefenpir / nombre general, mefenpir-etil / nombre general, mefenpir-dietil / nombre general, mefenato / nombre general, MG-191, NA (naftálico anhídrido), OM (octametileno-diamina), oxabetrinil / nombre general, PPG-1292, y R-29148. Estos componentes activos quimicos agricolas se pueden utilizar solos o en combinaciones de dos o más de ellos. Cuando estos componentes se mezclan, la proporción de mezcla puede ser libremente seleccionada.

Aunque la cantidad de aplicación del compuesto de la presente invención varía dependiendo de la situación de aplicación, el tiempo de aplicación, el método de aplicación, la cosecha cultivada y similares, la cantidad de aplicación apropiada es generalmente 0,005 kg/ha a 50 kg/ha como la cantidad de componente activo.

A continuación, se describirán los ejemplos de formulación de las formulaciones herbicidas cuando se utiliza el compuesto de la presente invención. Sin embargo, los ejemplos de formulación de la presente invención no se limitan a estos ejemplos. En lo sucesivo, el término "parte" en los ejemplos de formulación se refiere a parte por peso.

Agentes dispersables en agua

Compuesto de la presente invención	0,1 partes a 80 partes
Vehículo sólido	5 partes a 98.9 partes
Tensioactivo	1 parte a 10 partes
Otros	0 partes a 5 partes

Ejemplos de otros pueden incluir agentes antiaglomerantes, agentes estabilizantes y similares.

Agente de Emulsión

Compuesto de la presente invención	0,1 partes a 30 partes
Vehículo líquido	45 partes a 95 partes
Tensioactivo	4,9 partes a 15 partes
Otros	0 partes a 10 partes

Ejemplos de otros pueden incluir agentes de dispersión, agentes estabilizantes y similares.

Agente de flujo

Compuesto de la presente invención	0,1 partes a 70 partes
Vehículo líquido	15 partes a 98,89 partes
Tensioactivo	1 parte a 12 partes
Otros	0,01 partes a 30 partes

Ejemplos de otros pueden incluir agentes anticongelantes, espesantes y similares.

Agente de flujo seco

Compuesto de la presente invención	0,1 partes a 90 partes
Vehículo sólido	0 partes a 98.9 partes
Tensioactivo	1 parte a 20 partes
Otros	0 partes a 10 partes

Ejemplos de otros pueden incluir aglutinantes, agentes estabilizantes y similares.

Agente líquido

Compuesto de la presente invención	0,01 partes a 70 partes
Vehículo líquido	20 partes a 99,99 partes
Otros	0 partes a 10 partes

Ejemplos de otros pueden incluir agentes anticongelantes, agentes de dispersión y similares.

Agente formador de gránulos

Compuesto de la presente invención	0,01 partes a 80 partes
Vehículo sólido	10 partes a 99.99 partes
Otros	0 partes a 10 partes

Ejemplos de otros pueden incluir aglutinantes, agentes estabilizantes y similares.

Agente en polvo

Compuesto de la presente invención	0,01 partes a 30 partes
Vehículo sólido	65 partes a 99.99 partes
Otros	0 partes a 10 partes

Ejemplos de Otros pueden incluir agentes antideslizantes, agentes estabilizantes y similares.

Cuando se utilizan los agentes, la formulación herbicida se aplica sin ningún tratamiento o al diluir el agente de 1 a 10.000 veces con agua.

Ejemplo de formulación herbicida

A continuación, se describirán ejemplos de formulación química agrícola que contienen el compuesto de la presente invención como el componente activo. La presente invención, sin embargo, no se limita a estos ejemplos. En lo sucesivo, el término "parte" en los ejemplos de formulación se refiere a parte por peso.

[Ejemplo de la Formulación 1] agente dispersable en agua

Compuesto de la presente invención	No. 1-001	20 partes
Pirofilita		76 partes
Sorpol 5039		2 partes
(Tensioactivo aniónico: fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd., nombre comercial)		
CARPLEX #80		2 partes
(Ácido silícico hidratado sintético: Shionogi & Co., Ltd., nombre comercial)		

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se pulverizan para proporcionar el agente dispersable en agua.

[Ejemplo de la Formulación 2] agente de emulsión

Compuesto de la presente invención	No. 1-001	5 partes
Xileno		75 partes
N-metilpirrolidona		15 partes
Sorpol 2680		5 partes
(Tensioactivo aniónico: fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd., nombre comercial)		

Los componentes anteriores se mezclan para proporcionar el agente de emulsión.

[Ejemplo de la Formulación 3] Agente de flujo

Compuesto de la presente invención	No. 1-001	25 partes
Agrisol S-710		10 partes
(El tensioactivo no iónico: Kao Corporation, nombre comercial)		
Lunox 1000C		0.5 partes
(Tensioactivo aniónico: fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd., nombre comercial)		
Goma xantano		0,02 partes

Agua 64,48 partes

Después de que los componentes anteriores se mezclan uniformemente, la mezcla se pulveriza en humedo para proporcionar el agente de fluidez.

[Ejemplo de la Formulación 4] Agente de flujo seco

Compuesto de la presente invención No. 1-001 75 partes

HITENOL NE-15 5 partes

(Tensioactivo aniónico: fabricado por DKS Co., Ltd., nombre comercial)

Vanillex N 10 partes

(Tensioactivo aniónico: Fabricado por NIPPON PAPER INDUSTRIES Co., LTD, nombre comercial)

CARPLEX #80 10 partes

(Ácido silícico hidratado sintético: Shionogi & Co., Ltd., nombre comercial)

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se pulverizan y después se añadió una pequeña cantidad de agua a la mezcla para agitar, mezclar, y amasar. La mezcla resultante se granula con un granulador de extrusión. Los gránulos se secaron para formar el agente de flujo seco.

[Ejemplo de Formulación 5] agente granular

Compuesto de la presente invención No. 1-001 1 parte

Bentonita 55 partes

Talco 44 partes

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se pulverizan y después se añadió una pequeña cantidad de agua a la mezcla para agitar, mezclar, y amasar. La mezcla resultante se granula con un granulador de extrusión. Los gránulos se secaron para proporcionar el agente granular.

Ejemplos

En lo sucesivo, la presente invención se describirá adicionalmente en detalle mediante la descripción específica de los Ejemplos de síntesis y Ejemplos de Ensayo de los compuestos de amidas heterocíclicas de Fórmula (1) en la presente invención como Ejemplos. La presente invención, sin embargo, no se limita a estos ejemplos.

Como una cromatografía líquida preparativa a presión media descrita en los Ejemplos de Síntesis y Ejemplos de Referencia, aparatos preparativos de presión media; YFLC-Wprep (tasa de

flujo: 18 ml/min, columna rellenada de gel de sílice 40 μm) fabricado por Yamazen Corporation.

Los valores de los desplazamientos químicos de resonancia magnética nuclear de protón en los Ejemplos se midieron a 300 MHz utilizando Me_4Si (tetrametilsilano) como una sustancia de referencia. Los disolventes utilizados en la medición se describen en los siguientes Ejemplos de síntesis. Los símbolos de los valores de desplazamiento químico de la resonancia magnética nuclear de protón en los Ejemplos tienen los siguientes significados.

S: singulete, d: doblete, t: triplete, m: multiplete, q: cuarteto y br: Ancho

Ejemplo de Síntesis

[Ejemplo de Síntesis 1]

3-isopropil-5-metil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida (Compuesto No. 1-003)

Paso 1; Síntesis de 2-hidrazinil-6-metilnicotinato de metilo

A la solución mixta de 3.0 g (16.2 mmol) de 2-cloro-6-metilnicotinato de metilo y 30 ml de dioxano, se añadió 1.62 g (32.3 mmol) de monohidrato de hidrazina a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó a 60° C durante 4 horas y posteriormente 80°C durante 6 horas. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (150 ml, 2 vez). La fase orgánica obtenida se lavó con una solución acuosa saturada de bicarbonato sódico. A partir de entonces, la fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con hexano y se filtró para proporcionar 1.60 g del producto diana como un sólido de color naranja.

Punto de fusión: 90°C a 91°C

Paso 2; Síntesis de 2-(2-isobutirilhidrazinil)-6-metilnicotinato de metilo

A la solución mixta de 1.5 g (8.28 mmol) de 2-hidrazinil-6-metilnicotinato de metilo, 838 mg (8.28 mmol) de trietilamina, y 20 ml de tetrahidrofurano, se añadió 882 mg (8.28 mmol) de cloruro de isobutirilo bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 30 minutos bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (100 ml, 1 vez). La fase orgánica obtenida se lavó con salmuera. A partir de entonces, la fase

orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con hexano y éter diisopropílico se filtró para proporcionar 1.68 g del producto diana como un sólido color carne.

Punto de fusión: 99°C a 101°C

Paso 3; Síntesis de 3-isopropil-5-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

A la solución mixta de 1.6 g (63.7 mmol) de 2-(2-isobutirilhidrazinil)-6-metilnicotinato de metilo y 10 ml de tolueno, 3 ml de cloruro de fosforilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 5 horas con calentamiento a reflujo. Después de terminar la agitación, la mezcla de reacción se añadió a agua helada para terminar la reacción. A partir de entonces, el líquido de reacción se lavó con acetato de etilo (50 ml, 1 vez). A la fase acuosa obtenida, se añadió carbonato de potasio bajo enfriamiento con hielo para ajustar el pH de 8 a 9. Por lo tanto, el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (100 ml, 2 vez). La fase orgánica obtenida se secó sobre sulfato de sodio y el solvente se separo por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 490 mg del producto deseado como un sólido amarillo claro.

Punto de fusión: 138°C a 140°C

Paso 4; Síntesis del ácido 3-isopropil-5-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

A la solución mixta de 450 mg (1.93 mmol) de 3-isopropil-5-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo y 4 ml de metanol, 2 ml de solución acuosa de hidroxido de sodio 1 M se añadió a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 2 horas a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, se añadió ácido clorhídrico 1 M para ajustar el pH a entre 2 y 3. Después de que el solvente en el líquido de reacción se separó por destilación bajo presión reducida, el sólido precipitado se lavó con agua y se filtró para proporcionar 250 mg del producto deseado como un sólido amarillo claro.

Punto de fusión: 194°C a 195°C

Paso 5; Síntesis de 3-isopropil-5-metil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida

A la solución mixta de 400 mg (1.95 mmol) del ácido 3-isopropil-5-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico, 0.1 ml de N,N-dimetilformamida, y 3 ml de cloruro de metileno, se añadió 463 mg (3.91 mmol) de cloruro de oxalilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición,

la mezcla de reacción se agitó durante 1 horas a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, el solvente en la mezcla de reacción se separó por destilación bajo presión reducida para proporcionar clorhidrato de cloruro del ácido 3-isopropil-5-metil-[4,3-a]triazolo[1,2,4]piridina-8-carboxílico crudo. A la solución mixta de 540 mg (1.95 mmol) clorhidrato de cloruro del ácido3-isopropil-5-metil- [1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico crudo obtenido, 180 mg (1.82 mmol) de 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-amina y 5 ml de cloruro de metileno, se añadió 368 mg (3.91 mmol) de trietilamina bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 20 horas a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, se añadió 5 ml de piridina y 10 mg de 4- (dimetilamino)piridina a la mezcla de reacción. A partir de entonces, La mezcla de reacción resultante se agitó a 68º C durante 10 horas. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (20 ml, 1 vez). La fase orgánica obtenida se lavó con salmuera. A partir de entonces, la fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de sodio anhidro y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y scetato de etilo y se filtró para proporcionar 60 mg del producto diana como un sólido de color marrón.

[Ejemplo de Síntesis 2]

3-isopropil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida (Compuesto No.1-004)

A la solución mixta de 160 mg (0.59 mmol) del ácido 3-isopropil-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico, 70 mg (0.71 mmol) de 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-amina, y 5 ml de N,N-dimetilformamida, 135 mg (0.71 mmol) de hidrocloruro de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida y se añadió 96 mg (0.71 mmol) de 1-hidroxi-7-azabenzotriazol. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 24 horas a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el líquido de reacción se extrajo con cloroformo (100 ml, 1 vez). La fase orgánica obtenida se lavó con salmuera. A partir de entonces, la fase orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en gel de sílice {n-hexano: acetato de etilo = 1:1 a 0:1 (proporción de volumen; lo mismo se aplica en lo sucesivo)} para proporcionar 90 mg del producto deseado como un sólido blanco.

Punto de fusión: 176°C a 178°C

[Ejemplo de Síntesis 3]

3-isopropil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(metiltio)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida (Compuesto No.1-009)

Paso 1; Síntesis de 2-hidrazinilo-6-cloronicotinato de metilo

A la solución mixta de 11.5 g (55.8 mmol) de 2,6-dicloronicotinato de metilo y 150 ml de dioxano, se añadió 5.58 g (111 mmol) de monohidrato de hidrazina a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 18 horas a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el solvente en el líquido de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con agua y se filtró para proporcionar 10.7 g del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 82 °C a 83 °C

Paso 2; Síntesis de 2-(2-isobutirilhidrazinil)-6-cloronicotinato de metilo

A la solución mixta de 5.0 g (24.8 mmol) de 2-hidrazinilo-6-cloronicotinato de metilo, 2.5 g (24.8 mmol) de trietilamina, y 20 ml de tetrahidrofurano, se añadió 2.64 g (24.8 mmol) de cloruro de isobutirilo bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 2 horas bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (150 ml, 1 vez). La fase orgánica obtenida se lavó con salmuera. A partir de entonces, la fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y hexano y se filtró para proporcionar 5.90 mg del producto diana como un sólido de color blanco.

Punto de fusión: 147 °C a 148 °C

Paso 3; Síntesis de 3-isopropil-5-cloro-[1,2,4]triazolo [4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

5.9 g (21.7 mmol) de 2- (2-isobutirilhidrazinil)-6-cloronicotinato y 20 ml de cloruro de fosforilo se mezclaron a temperatura ambiente y a partir de entonces la mezcla de reacción se agitó durante 5 horas con calentamiento a reflujo. Después de terminar la agitación, la mezcla de reacción se añadió a agua helada para terminar la reacción. Por lo tanto, el líquido de reacción se lavó con acetato de etilo (50 ml, 1 vez). Se añadió carbonato de potasio a la fase acuosa obtenida

bajo enfriamiento con hielo para ajustar el pH entre 8 y 9 y el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (200 ml, 2 veces). La fase orgánica obtenida se secó sobre sulfato de sodio y el solvente se separo por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 4.75 g del producto diana como un sólido amarillo claro.
Punto de fusión: 105°C a 107°C

Paso 4; Síntesis de 3-isopropil-5-(metiltio)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

A la solución mixta de 420 mg (1.66 mmol) de 3-isopropil-5-cloro-[1,2,4]triazolo [4,3-a] piridina-8-carboxilato de metilo y 3 ml de N,N-dimetilformamida , se añadió 140 mg (1.99 mmoles) de tiometóxido de sodio bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 45 horas bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (30 ml, 3 vez). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego con sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 280 mg del producto diana como un sólido amarillo claro.
Punto de fusión: 142°C a 145°C

Paso 5; Síntesis de 3-isopropil-5-metil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(metiltio)-[1,2,4]riazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida

A la solución mixta de 140 mg (0.53 mmol) de 3-isopropil-5-(metiltio)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo, 3 ml de metanol, y 1 ml de agua se añadió 0.6 ml de solución acuosa de hidroxido de sodio 1 M a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 17 horas a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de 1 ml de ácido clorhídrico 1 M. El solvente en la mezcla de reacción se separó por destilación bajo presión reducida para proporcionar clorhidrato de cloruro del ácido 3-isopropil-5-(metiltio)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico crudo. A la solución mixta de 190 mg (0.53 mmol) ácido3-isopropil-5-(metiltio)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico crudo obtenido, 104 mg (1.06 mmol) de 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-amina y 3ml de piridina, se añadió 126 mg (1.06 mmol) de cloruro de tionilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó a 60° C durante 5 horas. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de

agua y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y cloroformo y se filtró para proporcionar 5.90 mg del producto diana como un sólido color ocre.

[Ejemplo de Síntesis 4]

3-cloro-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida (Compuesto No. 1-013)

Paso 1; Síntesis del àcido 3-cloro-5- (trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

A la solución mixta de 300 mg (1.30 mmol) del àcido 5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo [4,3-a]piridina-8-carboxílico y 6 ml de N,N-dimetilformamida, se añadió 347 mg (2.60 mmol) de N-clorosuccinimida a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó a 60° C durante 4 horas. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (50 ml, 2 vez). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego con sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 210 mg del producto diana como un sólido amarillo claro.

Paso 2; Síntesis de 3-chloro-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[l,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida

A la solución mixta de 70 mg (0.26 mmol) del àcido 3-cloro-5- (trifluorometil)-[1,2,4]triazolo [4,3-a]piridina-8-carboxílico, 52 mg (0.53 mmol) de 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-amina, 10 mg (0.03 mmol) de 4-(dimetilamino)piridina y 5 ml de piridina, se añadió 63 mg (0.53 mmol) de cloruro de tionilo a temperatura ambiente . La mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el líquido de reacción se extrajo con cloroformo (15 ml, 3 vez). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego con sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 52 mg del producto deseado como un sólido amarillo claro.

Punto de fusión: 238°C a 241°C

[Ejemplo de Síntesis 5]

3-isopropil-N-(4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida (Compuesto No. 3-001)

A la solución mixta de 165 mg (0.60 mmol) del ácido 3-isopropil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico, 0.1 ml de N,N-dimetilformamida, y 5 ml de cloruro de metileno, se añadió 83 mg (0.66 mmol) de cloruro de oxalilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 20 horas a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, se añadió la solución mixta de 119 mg (1.21 mmol) de 4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-amina, 122 mg (1.21 mmol) de trietilamina y 3 ml de cloruro de metileno. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. Después terminar la agitación, el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en gel de sílice (n-hexano: acetato de etilo = 9:1 a 2:1 para proporcionar 168 mg del producto diana como un sólido blanco.
Punto de fusión: 185°C a 186°C

[Ejemplo de Síntesis 6]

5-cloro-3-isopropil-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-[1,2,4] triazolo [4,3-a] piridina-8-carboxamida (Compuesto No. 2-004)

A la solución mixta de 500 mg (1.97 mmol) de 5-cloro-3-isopropil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo, 3 ml de metanol, y 1 ml de agua se añadió 2 ml de solución acuosa de hidroxido de sodio 1 M bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de 2,5 ml de ácido clorhídrico 1 M. El solvente en el liquido de reacción se separó por destilación bajo presión reducida para proporcionar àcido 5-cloro-3-isopropil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxìlico crudo. A la solución mixta de 500 mg (1.97 mmol) del àcido 5-cloro-3-isopropil- [1,2,4]triazolo [4,3-a]piridina-8-carboxílico, 390 mg (3.94 mmol) de 1-metil-1H-tetrazol-5-amina, 24 mg (0.19 mmol) de 4-(dimetilamino)piridina y 5 ml de piridina, se añadió 469 mg (3.94 mmol) de cloruro de tionilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 2 dias a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (50 ml, 2 vez). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego con sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El

residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en gel de sílice (n-hexano: acetato de etilo = 4:1 a 1:1) para proporcionar 140 mg del producto diana como un sólido amarillo claro.

Punto de fusión: 189°C a 190°C

[Ejemplo de Síntesis 7]

3-(metoximetil)-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida (Compuesto No. 2-010)

Paso 1; Síntesis de 2-(2-(2-metoxiacetil) hidrazinilo)-6-(trifluorometil)nicotinato de metilo (Compuesto No. A1-05a)

A la solución mixta de 1.0 g (4.25 mmol) de 2-hidrazinil-6-(trifluorometil)nicotinato, 473 mg (4.68 mmol) de trietilamina, y 20 ml de solución de tetrahidrofurano, se añadió 508 mg (4.68 mmol) de cloruro de metoxiacetilo bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 30 minutos bajo enfriamiento con hielo. Después terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. Después se añadieron 15 ml de agua, la mezcla se extrajo con cloroformo (30 ml, 1 vez y 10 ml, 2 veces). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego con sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 1.16 g del producto diana como un sólido blanco.

Punto de fusión: 76°C a 77°C

Paso 2; Síntesis de 3-(metoximetil)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a] piridina-8-carboxilato de metilo (Compuesto No. B1-05a)

A la solución mixta de 1.16 g (3.78 mmol) de 2-(2-(2-metoxiacetil)hidrazinil)-6-(trifluorometil)nicotinato y 17 ml de tolueno, se añadió +1.74 g (11.3 mmol) de cloruro de fosforilo a temperatura ambiente. Después de determinar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 5 horas con calentamiento a reflujo. Después de terminar la reacción, la solución de reacción se vertió en 20 ml de agua preparados por separado. Se añadió una solución acuosa de hidrogenocarbonato para ajustar el pH entre 8 y 9 y a partir de entonces la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (30 ml, 1 vez y 15 ml, 3 veces). La fase orgánica combinada se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego con sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 721 mg del producto

deseado como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 95°C a 97°C

Paso 3; Síntesis del ácido 3- (metoximetil)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico (Compuesto No. C1-05)

A la solución mixta de 693 mg (2.39 mmol) de 3-(metoximetil)-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo y 7 ml de etanol, se añadieron 7 ml de solución acuosa de 115 mg (2.87 mmol) de hidróxido de sodio bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 30 minutos bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la agitación, se añadió ácido clorhídrico 1 M para ajustar el pH entre 2 y 3. A partir de entonces, la mezcla resultante se extrajo con cloroformo (30 ml, 1 vez y 15 ml, 3 veces). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 553 mg del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 111°C a 112°C

Etapa 4; Síntesis de3-(metoximetil)-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida

A la solución mixta de 100 mg (0.36 mmol) del àcido 3-(metoximetil)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico, 72 mg (0.73 mmol) de 1-metil-1H-tetrazol-5-amina, 5 mg (0.03 mmol) de 4-dimetilaminopiridina y 2 ml de piridina, se añadió 87 mg (0.73 mmol) de cloruro de tionilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. Después terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. Al residuo obtenido, se añadió ácido clorhídrico 1 mol/L para ajustar el pH entre 2 y 3. A partir de entonces, la mezcla resultante se extrajo con cloroformo (15 ml, 3 veces). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 76 mg del producto diana como un sólido blanco.

Punto de fusión: 205°C a 209°C

[Ejemplo de Síntesis 8]

N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(metiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-

a]piridina-8-carboxamida (Compuesto No. 1-018)

Paso 1; Síntesis de 3-tioxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a] piridina-8-carboxilato de metilo

La solución mixta de 1.0 g (4.25 mmol) de 2-hidrazinilo-6-(trifluorometil)nicotinato de metilo, 795 mg (4.46 mmol) de 1,1'-tiocarbonildiimidazol, y se agitó10 ml de N, N-dimetilformamida a 60 ° C durante 3 horas. Después terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 534 mg de la mezcla del producto diana y imidazol como un sólido rojo.

Paso 2; Síntesis de 3-(metiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

A 10 ml de solución de N, N-dimetilformamida de 534 mg de 3-tioxo-5-(trifluorometil) -2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a] piridina-8- carboxilato de metilo obtenido en la Etapa 1 que contiene imidazol, se añadió 402 mg de yoduro de metilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 1.5 horas. Después terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. Se añadió 15 ml de agua al residuo obtenido y la mezcla resultante se extrajo con cloroformo (15 ml, 3 veces). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 336 mg del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 163°C a 167°C

Paso 3; Síntesis del ácido 3-(metiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

A la solución mixta de 332 mg (1.14 mmol) de 3-(metiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo y 3 ml de metanol, se añadió 2.8 ml (1.4 mmol) de 0.5 mol/L solución acuosa de hidróxido bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 1hora bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la reacción, se añadió 1 mol/L de ácido clorhídrico a la solución de reacción para ajustar el pH entre 2 y 3. El sólido precipitado se lavó con 1 mol/L de ácido clorhídrico, agua y eter diisopropilico y se filtró para proporcionar 228 mg del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 158°C a 162°C

Paso 4; Síntesis de N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(metiltio)-5-(trifluorometil)-[l,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida

A la solución mixta de 100 mg (0.36 mmol) del àcido 3-(metiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico, 71 mg (0.72 mmol) de 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-amina, 4 mg de 4-dimetilaminopiridina, y 2 ml de piridina, se añadió 129 mg (1.08 mmol) de cloruro tionilo bajo enfriamento con hielo. Después de terminar la adición, la solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 20 minutos. Después terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. Al residuo obtenido, se añadió ácido clorhídrico 1 mol/L para ajustar el pH entre 2 y 3. A partir de entonces, la mezcla resultante se extrajo con cloroformo (15 ml, 3 veces). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 100 mg del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 230°C a 233°C

[Ejemplo de Síntesis 9]

3-iIsopropil-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carbotioamida (Compuesto No. 2-039)

La solución mixta de 100 mg (0.28 mmol) de 3-isopropil-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida,114 mg (0.28 mmol) de reactivo de Lawesson [2,4-bis (4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiadifosfetano-2,4-disulfuro], y se agitó 3 ml de tolueno a 110 ° C durante 5 horas. Después de terminar la agitación, se añadió 114 mg (0.28 mmol) de reactivo de Lawesson a la solución de reacción y la solución resultante se agitó adicionalmente a 110 ° C durante 3 horas. Después de terminar la reacción, se añadió 5 ml de ácido clorhídrico 0.1 N a la solución de reacción y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (15 ml, 1 vez). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El residuo obtenido se purificó con la cromatografía líquida preparativa de presión media eluyendo el residuo con acetato de n-hexano (gradiente de 4: 1 a 3: 7) para proporcionar 66 mg del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 198°C a 200°C

[Ejemplo de Síntesis 10]

3-Alil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida y N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida (compuesto No. 1-159 y compuesto No. 1-159 *)

Paso 1; Síntesis de 3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo y 3- (prop-1-en-1-il) -5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

A la solución mixta de 1.20 g (3.96 mmol) de 2-(2-(but-3-enoil)hidrazinil)-6-(trifluorometil)nicotinato de metilo sintetizado en un método similar a la Etapa 1 en el Ejemplo de síntesis 7 y 18 ml de tolueno, se añadió 1.82 g (11.9 mmol) de cloruro de fosforilo a temperatura ambiente. Después de determinar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 5 horas con calentamiento a reflujo. Después de terminar la reacción, la solución de reacción se vertió en 20 ml de agua preparados por separado. Se añadió una solución acuosa de hidrogenocarbonato para ajustar el pH entre 8 y 9 y a partir de entonces la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (30 ml, 1 vez y 15 ml, 3 veces). La fase orgánica combinada se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego con sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El residuo obtenido se purificó con cromatografía líquida preparativa de presión media eluyendo el residuo con acetato de n-hexano-etilo (gradiente de 7:3 a 0:1) para proporcionar 730 mg del producto diana como un sólido blanco [3-alil-5-(trifluorometil) - [1,2,4] triazolo [4,3-a] piridina-8-carboxilato de metilo/ 3- (prop-1-en-1-il) -5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a] piridina-8-carboxilato de metilo = 4/1].

^{1}H NMR de3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 7.97 (d, 1H, J = 7.2Hz), 7.44 (d, 1H, J = 7.2Hz), 6.31-6.20 (m, 1H), 5.26-5.12 (m, 2H), 4.10 (s, 3H), 4.00 (dd, 2H, J = 6.3Hz, 1.2Hz).

^{1}H NMR de 3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílato de metilo ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 7.94 (d, 1H, J=6.0Hz), 7.42 (d, 1H, J=6.0Hz), 7.00-6.90 (m, 1H), 6.66-6.58 (m, 1H), 4.10 (s, 3H), 2.04 (dd, 3H, J=6.6Hz, 1.8Hz).

Punto de fusión: 121°C a 123°C

Paso 2; Síntesis del ácido 3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina -8-carboxílico y ácido 3- (prop-1-en-1-il) -5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a] piridina-8-carboxílico

A la solución mixta de 720 mg (2.65 mmol) de la mezcla de 3-alil-5- (trifluorometil) -

[1,2,4]triazolo[4,3-a] piridina-8-carboxilato de metilo y 3- (prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo y 10 ml de etanol, se añadió 7.0 ml (3.5 mmol) de 0.5 mol/L de solución acuosa de hidróxido de sodio bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 30 minutos bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la agitación, se añadió ácido clorhídrico 1 M para ajustar el pH entre 2 y 3. A partir de entonces, la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (15 ml, 2 veces). La fase orgánica obtenida se deshidrató y se secó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó mediante destilación bajo presión reducida para proporcionar 467 mg del producto deseado como un sólido blanco ácido [3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico/ácido 3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)- [1,2, 4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico = 4/1].

^{1}H NMR de ácido 3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 8.25 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.61 (d, 1H, 7.5Hz), 6.34-6.20 (m, 1H), 5.35-5.22 (m, 2H), 4.00 (dd, 2H, J=6.3Hz, 1.2Hz). (No se observó el pico del protón CO2H).

^{1}H NMR de ácido3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 8.22 (d, 1H, J=8.1Hz), 7.58 (d, 1H, J=8.1Hz), 7.12-7.00 (m, 1H), 6.67-6.60 (m, 1H), 2.07 (dd, 3H, J=6.9Hz, 1.8Hz). (No se observó el pico del protòn CO_2H).

Punto de fusión: 103°C a 104°C

Paso 3; Síntesis de 3-alil-N- (5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)[l, 2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida y N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida

A la solución mixta de 100 mg (0.37 mmol) de la mezcla del ácido 3-alil-5-(trifluorometil) -[1,2,4]triazolo[4,3-a] piridina-8-carboxílico y ácido 3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico, 55 mg (0.55 mmol) de 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-amina, 5 mg (0.04 mmol) de 1-hidroxi-7-azabenzotriazol y 2 ml de N,N-dimetilformamida, se añadió 106 mg (0.55 mmol) de hidrocloruro de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, se añadió 3 ml de mol/ácido clorhídrico y el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (10 ml, 2 vez). La fase orgánica obtenida se lavó con salmuera. A partir de entonces, la fase orgánica se secó sobre sulfato de sodio

anhidro y el solvente se separo por destilación bajo presión reducida. El sólido obtenido se purificó mediante recristalización a partir de acetato de etilo para proporcionar 67 mg del producto diana como un sólido amarillo claro.

[3-alil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[l,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida/ N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida = 4/1].

^{1}H NMR de 3-alil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[l,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 12.9 (brs, 1H), 8.42 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.63 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.38-6.24 (m, 1H), 5.36-5.23 (m, 2H), 4.03 (dd, 2H, J=6.9Hz, 1.2Hz), 2.59 (s, 3H).

^{1}H NMR de N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 12.9 (brs, 1H), 8.38 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.60 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.12-7.00 (m, 1H), 6.69-6.62 (m, 1H), 2.60 (s, 3H), 2.09 (dd, 3H, J=6.6Hz, 1.8Hz).

Punto de fusión: 159°C a 161°C

[Ejemplo de Síntesis 11]

3-Alil-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida y N-(1-metil-1H-terazol-5-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida (compuesto No. 2-105 y compuesto No. 2-105 *)

A la solución mixta de 100 mg (0.37 mmol) de la mezcla de ácido 3-alil-5-(trifluorometil) -[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico y ácido 3-(prop-1-en-1-il) -5- (trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico sintetizado en el Paso 2 del Ejemplo de Síntesis 7, 56 mg (0.57 mmol) de 1-metil-1H- tetrazol-5-amina, y 2 ml de piridina, se añadió 66 mg (0.55 mmol) de cloruro de tionilo a una temperatura de 15 °C o inferior. Después de terminar la adición, la temperatura de la solución de reacción se mantuvo a 15°C o menos y se agitó durante 1.5 horas. Después terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. Al residuo obtenido, se añadió1.5 ml de acetonitrilo y 2 ml de ácido clorhídrico 1 mol / L y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (10 ml, 2 veces). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con acetato de etilo y se filtró para proporcionar 27 mg del producto diana como un sólido

de color marrón claro. [3-alil-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida/N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[l, 2,4] triazolo [4,3-a] piridina-8-carboxamida = 3/1].

^{1}H NMR de 3-alil-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 12.5 (brs, 1H), 8.40 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.65 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.37-6.24 (m, 1H), 5.37-5.24 (m, 2H), 4.13 (s, 3H), 4.06 (dd, 2H, J=6.6Hz, 1.2Hz).

^{1}H NMR de N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[l,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 12.5 (brs, 1H),8.36 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.62 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.13-7.01 (m, 1H), 6.70-6.62 (m, 1H), 4.13 (s, 3H), 2.10 (dd, 3H, J=6.6Hz, 1.5Hz).

Punto de fusión: 164°C a 167°C

[Ejemplo de Síntesis 12]

3-(2,2-dicloro-1-metilciclopropil)-N-etil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida (compuesto No. 1-174)

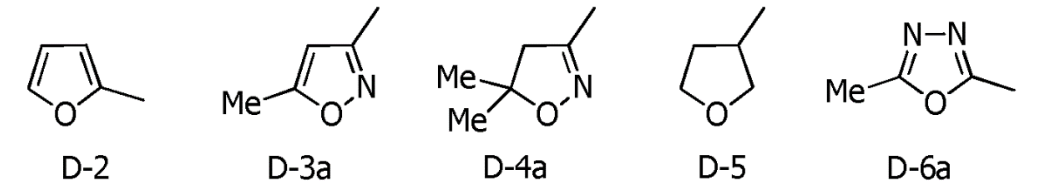
A 1 ml de solución de N,N-dimetilformamida de 67 mg de 3-(2,2-dicloro-1-metilciclopropil)-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida, se añadió 31 mg de carbonato de potasio y 48 mg de yoduro de etilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó a 55° C durante 30 minutos. Después de terminar la reacción, se añadió 2 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (3 ml, 2 vez). La fase orgánica obtenida se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de magnesio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El residuo obtenido se purificó con cromatografía líquida preparativa de presión media eluyendo el residuo con acetato de n-hexano-etilo (gradiente de 2:1 a 0:1) para proporcionar 21 mg del producto diana como una sustancia resinosa incolora.

^{1}H NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 7.72 (d, 1H, J=7.8Hz), 7.53 (d, 1H, J=7.8Hz), 4.15 (q, 2H, J=7.2Hz), 2.78 (d, 1H, J=7.8Hz), 2.38 (s, 3H), 1.83 (d, 1H, J=7.8Hz), 1.80 (s, 3H), 1.43 (t, 3H, J=7.2Hz).

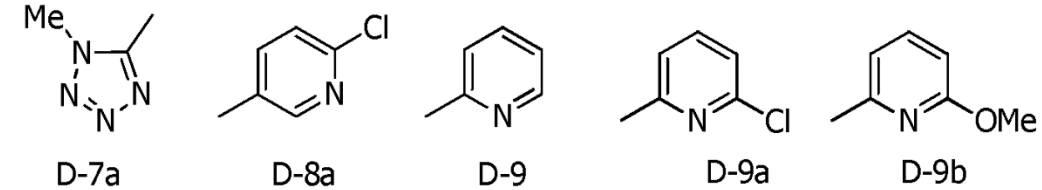
El compuesto de la presente invención se puede sintetizar de acuerdo con los Ejemplos de Síntesis descritos anteriormente. Ejemplos de los compuestos de la presente invención producidos en los métodos similares al Ejemplo de Síntesis 1 a Ejemplo de Síntesis 9 se listan en la cuarta

Tabla a décima Tabla. La presente invención, sin embargo, no se limita a estos ejemplos. En las Tablas, Me es un grupo metilo. Del mismo modo, Et es un grupo etilo, Pr es un grupo propilo, Pen es un grupo pentilo, Hex es un grupo hexilo, Ph es un grupo fenilo, Bn es un grupo bencilo, i- es iso, c- es ciclo, y t es terciario.

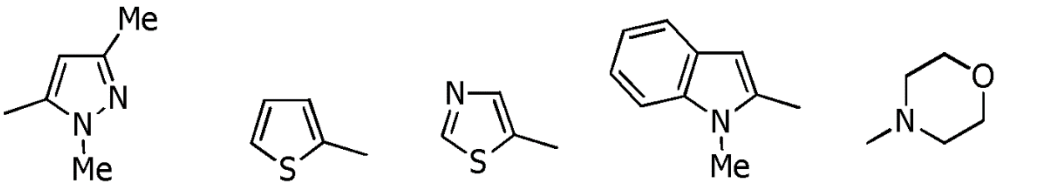
Los sustituyentes de D-2, D-3a, D-4a, D-5, D-6a, D-7a, D-8a, D-9, D-9a, D-9b, D-10a, D-11, D-12, D-13a, D-14, D-15, D-16a, D-16m, D-17, D-17a, D-17b, D-18, D-19, D-20a, D-23a, y D-24f En las tablas son las siguientes estructuras:



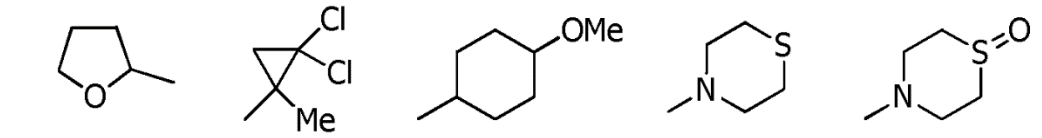
D-2 D-3a D-4a D-5 D-6a



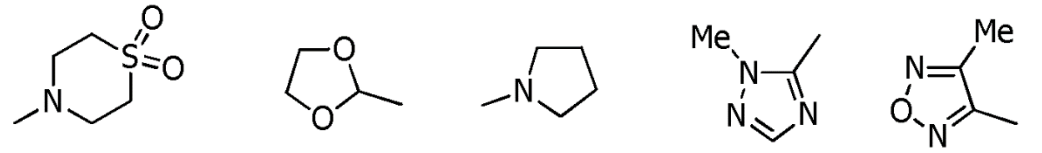
D-7a D-8a D-9 D-9a D-9b



D-10a D-11 D-12 D-13a D-14



D-15 D-16a D-16m D-17 D-17a



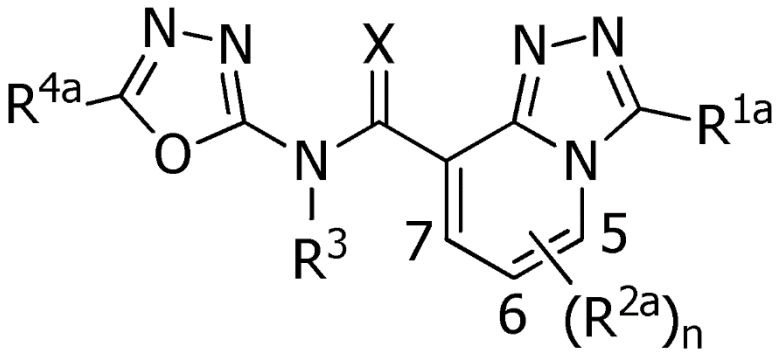
D-17b D-18 D-19 D-20a D-23a

D-24f

En las tablas "*1" es "Resinoso". "*2" significa que la descomposición fue observada al momento de la medida del punto de fusión. "*3" es una mezcla de los compuestos 1-158 y 1-158* ode la presente invención y son isómeros que tienen estructuras diferentes y la proporción de ambas 1-

158/1-158* equivale a 9/1. Como se describe en el ejemplo de síntesis 10, "*4" es la mezcla de los compuestos 1-159 y 1-159* de la presente invención, que son isómeros que tienen estructuras diferentes y la proporción de las mismas 1-159/1-159* equivale a 4/1. Como se describe en el ejemplo de síntesis11, "*5" es la mezcla de los compuestos 2-105 y 2-105* de la presente invención que son isómeros que tienen estructuras diferentes y la proporción de las mismas 2-105/2-105* equivale a 3/1.

[0249] [Cuarta Tabla]



[Tabla 27]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{4a}	Punto de fusión (°C)
1-001	H	5-CF_3	O	H	Me	220-223
1-002	Me	5-CF_3	O	H	Me	242-245
1-003	i-Pr	5-Me	O	H	Me	*2
1-004	i-Pr	5-CF_3	O	H	Me	176-178
1-005	i-Pr	5-CF_3	O	H	Et	176-180
1-006	i-Pr	5-CF_3	O	H	Bn	141-150
1-007	i-Pr	5-CF_3	O	H	Ph	173-177
1-008	i-Pr	5-CF_3	O	H	D-2	152-156
1-009	i-Pr	5-SMe	O	H	Me	*2
1-010	c-Pr	5-CF_3	O	H	Me	157-165
1-011	3-Pen	5-CF_3	O	H	Me	171-174
1-012	Ph	5-CF_3	O	H	Me	266-270
1-013	Cl	5-CF_3	O	H	Me	238-241
1-014	Br	5-CF_3	O	H	Me	252-260
1-015	CH_2OMe	5-CF_3	O	H	Me	115-125
1-016	4-MeO-Ph	5-CF_3	O	H	Me	205-208
1-017	4-Cl-Ph	5-CF_3	O	H	Me	256-258
1-018	SMe	5-CF_3	O	H	Me	230-233
1-019	$CH_2O(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	90-91
1-020	$CH_2OCH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	148-149
1-021	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	160-162
1-022	D-3a	5-CF_3	O	H	Me	218-221
1-023	i-Pr	6-CF_3	O	H	Me	160-162
1-024	n-Pr	5-CF_3	O	H	Me	172-176
1-025	CH_2OPh	5-CF_3	O	H	Me	188-190
1-026	c-Pen	5-CF_3	O	H	Me	170-171
1-027	CH_2OEt	5-CF_3	O	H	Me	141-143
1-028	tBu	5-CF_3	O	H	Me	161-165
1-029	D-4a	5-CF_3	O	H	Me	172-176
1-030	CH_2SMe	5-CF_3	O	H	Me	153-155
1-031	$CH_2SCH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	162-163
1-032	SEt	5-CF_3	O	H	Me	182-184
1-033	$SCH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	186-188
1-034	S(O)Et	5-CF_3	O	H	Me	192-193
1-035	$S(O)CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	153-157
1-036	$CH_2S(O)Me$	5-CF_3	O	H	Me	190-191
1-037	$CH_2S(O)_2Me$	5-CF_3	O	H	Me	*1
1-038	$CH_2S(O)CH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	200-202
1-039	$CH_2S(O)_2CH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	*1
1-040	$S(O)_2Me$	5-CF_3	O	H	Me	*1
1-041	$S(O)_2Et$	5-CF_3	O	H	Me	*1
1-042	$CH_2C(O)OEt$	5-CF_3	O	H	Me	187-189
1-043	4-Me-Ph	5-CF_3	O	H	Me	221-223
1-044	4-F-Ph	5-CF_3	O	H	Me	203-208
1-045	4-CF_3-Ph	5-CF_3	O	H	Me	196-198
1-046	3-MeO-Ph	5-CF_3	O	H	Me	178-182
1-047	2-MeO-Ph	5-CF_3	O	H	Me	180-185
1-048	$CH_2C(O)OH$	5-CF_3	O	H	Me	139-141

[Tabla 28]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{4a}	Punto de fusión (°C)
1-049	$CH_2C(O)OCH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	157-159
1-050	i-Pr	5-CF_3	O	H	H	171-175
1-051	i-Pr	5-CF_3	O	H	c-Pr	161-162
1-052	i-Pr	5-CF_3	O	H	$(CH_2)_2OMe$	125-135
1-053	i-Pr	5-CF_2H	O	H	Me	160-162
1-054	D-8a	5-CF_3	O	H	Me	240-243
1-055	D-9a	5-CF_3	O	H	Me	205-208
1-056	D-10a	5-CF_3	O	H	Me	274-275
1-057	D-11	5-CF_3	O	H	Me	222-224
1-058	D-12	5-CF_3	O	H	Me	213-216
1-059	D-13a	5-CF_3	O	H	Me	272-274
1-060	$CH_2C(O)O(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	152-153
1-061	$CH_2C(O)NHCH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	222-227
1-062	$CH_2OC(O)Me$	5-CF_3	O	H	Me	165-167
1-063	$S(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	99-101
1-064	$SCH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	213-217
1-065	$SCH_2C\equiv CH$	5-CF_3	O	H	Me	114-117
1-066	i-Pr	5-CF_2CF_3	O	H	Me	193-195
1-067	CH_2OH	5-CF_3	O	H	Me	236-238
1-068	CHO	5-CF_3	O	H	Me	222-223
1-069	CH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	172-174
1-070	3,5-$(MeO)_2$-Ph	5-CF_3	O	H	Me	228-229
1-071	3,5-$(Cl)_2$-Ph	5-CF_3	O	H	Me	254-256
1-072	CH=NOMe	5-CF_3	O	H	Me	204-207
1-073	$S(O)(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	199-201
1-074	$S(O)CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	134-137
1-075	i-Pr	5-CF_3-6-Me	O	H	Me	168-169
1-076	NMe_2	5-CF_3	O	H	Me	184-185
1-077	$S(O)CH_2C\equiv CH$	5-CF_3	O	H	Me	205-212
1-078	CH(Me)SMe	5-CF_3	O	H	Me	137-139
1-079	CH(Me)S(O)Me	5-CF_3	O	H	Me	127-129
1-080	$CH(Me)S(O)_2Me$	5-CF_3	O	H	Me	159-160
1-081	i-Pr	5-Ph	O	H	Me	131-133
1-082	NHPh	5-CF_3	O	H	Me	179-182
1-083	$(CH_2)_2SMe$	5-CF_3	O	H	Me	157-159
1-084	$(CH_2)_2S(O)Me$	5-CF_3	O	H	Me	179-181
1-085	$(CH_2)_2S(O)_2Me$	5-CF_3	O	H	Me	191-192
1-086	N(Me)Ph	5-CF_3	O	H	Me	175-178
1-087	$S(CH_2)_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	141-142
1-088	i-Pr	5-{3,5-$(F)_2$-Ph}	O	H	Me	191-193
1-089	i-Pr	5-CF_3-7-Me	O	H	Me	120-124
1-090	$NHCH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	163-164
1-091	$SCH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	H	211-213
1-092	$S(O)(CH_2)_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	193-195
1-093	$SCH_2CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	143-145
1-094	$SCH(CH_3)CH_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	150-153
1-095	$SC(CH_3)_3$	5-CF_3	O	H	Me	178-180
1-096	D-14	5-CF_3	O	H	Me	166-168

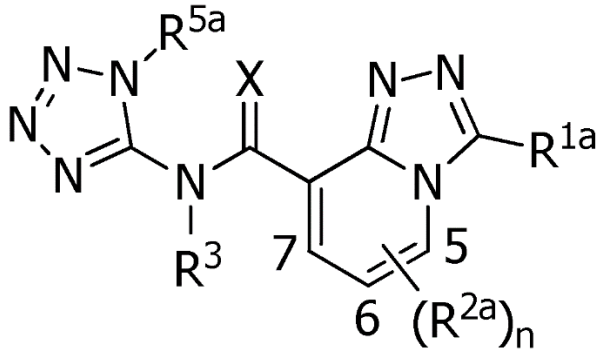
[Tabla 29]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{4a}	Punto de fusión (°C)
1-097	i-Pr	5-CF_3	O	H	D-15	108-111
1-098	i-Pr	5-CF_3	O	H	D-14	*1
1-099	i-Pr	5-CF_3	O	H	4-MeO-Ph	154-158
1-100	i-Pr	5-CF_3	O	H	CF_3	111-116
1-101	i-Pr	5-CF_3	O	H	D-9	167-169
1-102	NH(D-9b)	5-CF_3	O	H	Me	219-221
1-103	NMe_2	5-CF_3	O	H	H	200-205
1-104	CH_2(c-Pr)	5-CF_3	O	H	Me	160-163
1-105	D-16a	5-CF_3	O	H	Me	232-235
1-106	SEt	5-CF_3	O	H	H	189-191
1-107	$CH_2O(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	H	117-118
1-108	$S(CH_2)_2CH_3$	5-CF_3	O	H	H	198-200
1-109	$NH(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	150-155
1-110	D-14	5-CF_3	O	H	H	180-182
1-111	$NHS(O)_2Ph$	5-CF_3	O	H	Me	259-261
1-112	OEt	5-CF_3	O	H	H	135-145
1-113	SCH_2Ph	5-CF_3	O	H	Me	187-190
1-114	SCH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	155-158
1-115	SCH_2(c-Pr)	5-CF_3	O	H	Me	135-137
1-116	SCH_2(D-15)	5-CF_3	O	H	Me	142-143
1-117	SCH_2CN	5-CF_3	O	H	Me	179-182
1-118	D-17	5-CF_3	O	H	Me	*1
1-119	D-17a	5-CF_3	O	H	Me	250-255
1-120	D-17b	5-CF_3	O	H	Me	235-238
1-121	$N(Me)(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	H	131-134
1-122	$N(Me)CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	H	155-157
1-123	N(Me)(c-Hex)	5-CF_3	O	H	H	64-66
1-124	SCH_2CF_3	5-CF_3	O	H	Me	156-157
1-125	$SCH_2C(O)CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	178-182
1-126	SCH_2(D-18)	5-CF_3	O	H	Me	200-203
1-127	$SCH_2C(O)OMe$	5-CF_3	O	H	Me	184-185
1-128	$SCH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	H	188-190
1-129	$N(Me)(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	75-80
1-130	$NH(CH_2)_2SMe$	5-CF_3	O	H	Me	111-115
1-131	$NHCH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	140-144
1-132	$N(Me)CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	164-168
1-133	N(Me)(c-Hex)	5-CF_3	O	H	Me	135-140
1-134	N(Me)Et	5-CF_3	O	H	Me	125-128
1-135	$N(Et)_2$	5-CF_3	O	H	Me	135-137
1-136	D-19	5-CF_3	O	H	Me	151-152
1-137	N(Me)Et	5-CF_3	O	H	H	141-143
1-138	$N(Et)_2$	5-CF_3	O	H	H	130-131
1-139	D-19	5-CF_3	O	H	H	217-218
1-140	i-Pr	5-CF_3	O	H	D-11	200-201
1-141	i-Pr	5-CF_3	O	H	CH_2SMe	114-116
1-142	i-Pr	5-CF_3	O	H	$CH_2S(O)_2Me$	171-173
1-143	i-Pr	5-CF_3	O	H	$CH_2S(O)Me$	149-150
1-144	c-Pr	5-CF_3	O	H	H	170-174

[Tabla 30]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{4a}	Punto de fusión (°C)
1-145	3-Pen	5-CF_3	O	H	H	228-231
1-146	CH_2SMe	5-CF_3	O	H	H	176-179
1-147	4-F-Ph	5-CF_3	O	H	H	222-226
1-148	3,5-$(MeO)_2$-Ph	5-CF_3	O	H	H	217-220
1-149	4-MeO-Ph	5-CF_3	O	H	H	210-213
1-150	D-8a	5-CF_3	O	H	H	244-248
1-151	CH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	H	187-190
1-152	N(Me)$CH_2C\equiv CH$	5-CF_3	O	H	Me	161-163
1-153	N(Me)$(CH_2)_2CN$	5-CF_3	O	H	Me	138-143
1-154	S(c-Pen)	5-CF_3	O	H	Me	153-155
1-155	S(c-Pen)	5-CF_3	O	H	H	214-216
1-156	SCH_2(D-8a)	5-CF_3	O	H	Me	171-172
1-157	SCH_2(D-8a)	5-CF_3	O	H	H	204-207
1-158	$CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	H	155-158(*3)
1-158*	CH=CHMe	5-CF_3	O	H	H	155-158(*3)
1-159	$CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	159-161(*4)
1-159*	CH=CHMe	5-CF_3	O	H	Me	159-161(*4)
1-160	$C\equiv CMe$	5-CF_3	O	H	H	*2
1-161	$C\equiv CMe$	5-CF_3	O	H	Me	>280
1-162	CH_2CF_3	5-CF_3	O	H	Me	199-203
1-163	N(Me)$CH_2C\equiv CH$	5-CF_3	O	H	H	216-218
1-164	N(Me)$(CH_2)_2CN$	5-CF_3	O	H	H	105-110
1-165	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	136-139
1-166	N(Me)$CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	127-129
1-167	N(Me)CH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	191-194
1-168	CH_2CN	5-CF_3	O	H	Me	196-199
1-169	D-16m	5-CF_3	O	H	Me	146-147
1-170	D-24f	5-CF_3	O	H	Me	182-185
1-171	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	H	180-185
1-172	N(Me)$CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	H	135-137
1-173	$(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	157-158
1-174	D-16a	5-CF_3	O	Et	Me	*1

[0250] [Quinta Tabla]



[Tabla 31]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{5a}	Punto de fusión (°C)
2-001	H	5-CF_3	O	H	Me	247-251
2-002	Me	5-CF_3	O	H	Me	215-219
2-003	i-Pr	5-CF_3	O	H	Me	215-220
2-004	i-Pr	5-Cl	O	H	Me	189-190
2-005	c-Pr	5-CF_3	O	H	Me	190-195
2-006	3-Pen	5-CF_3	O	H	Me	143-144
2-007	Ph	5-CF_3	O	H	Me	245-247
2-008	Cl	5-CF_3	O	H	Me	193-195
2-009	Br	5-CF_3	O	H	Me	186-193
2-010	CH_2OMe	5-CF_3	O	H	Me	205-209
2-011	4-MeO-Ph	5-CF_3	O	H	Me	173-177
2-012	4-Cl-Ph	5-CF_3	O	H	Me	256-258
2-013	SMe	5-CF_3	O	H	Me	210-215
2-014	$CH_2O(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	152-154
2-015	$CH_2OCH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	170-171
2-016	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	181-184
2-017	D-3a	5-CF_3	O	H	Me	251-253
2-018	i-Pr	6-CF_3	O	H	Me	169-171
2-019	n-Pr	5-CF_3	O	H	Me	149-150
2-020	CH_2OPh	5-CF_3	O	H	Me	116-117
2-021	c-Pen	5-CF_3	O	H	Me	197-201
2-022	D-5	5-CF_3	O	H	Me	147-149
2-023	i-Pr	5-CF_3	O	Me	Me	215-216
2-024	SEt	5-CF_3	O	H	Me	157-159
2-025	$SCH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	200-204
2-026	CH_2OEt	5-CF_3	O	H	Me	183-184
2-027	tBu	5-CF_3	O	H	Me	217-218
2-028	D-4a	5-CF_3	O	H	Me	186-188
2-029	CH_2SMe	5-CF_3	O	H	Me	189-191
2-030	$CH_2SCH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	155-158
2-031	S(O)Et	5-CF_3	O	H	Me	190-191
2-032	$S(O)CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	163-167
2-033	$CH_2S(O)Me$	5-CF_3	O	H	Me	204-206
2-034	$CH_2S(O)_2Me$	5-CF_3	O	H	Me	212-214
2-035	$CH_2S(O)CH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	138-142
2-036	$CH_2S(O)_2CH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	176-178
2-037	$S(O)_2Me$	5-CF_3	O	H	Me	*1
2-038	$S(O)_2Et$	5-CF_3	O	H	Me	*1
2-039	i-Pr	5-CF_3	S	H	Me	198-200
2-040	$CH_2C(O)OEt$	5-CF_3	O	H	Me	202-204
2-041	i-Pr	5-CF_3	O	H	CH_2CH_2OMe	*1
2-042	4-Me-Ph	5-CF_3	O	H	Me	221-225
2-043	4-F-Ph	5-CF_3	O	H	Me	236-240
2-044	3-MeO-Ph	5-CF_3	O	H	Me	210-212
2-045	2-MeO-Ph	5-CF_3	O	H	Me	150-153
2-046	i-Pr	5-CF_3	O	H	$CH_2C(O)OMe$	149-154
2-047	i-Pr	5-CF_2H	O	H	Me	172-173
2-048	i-Pr	5-CF_3	O	H	CH_2CH_2SMe	*1

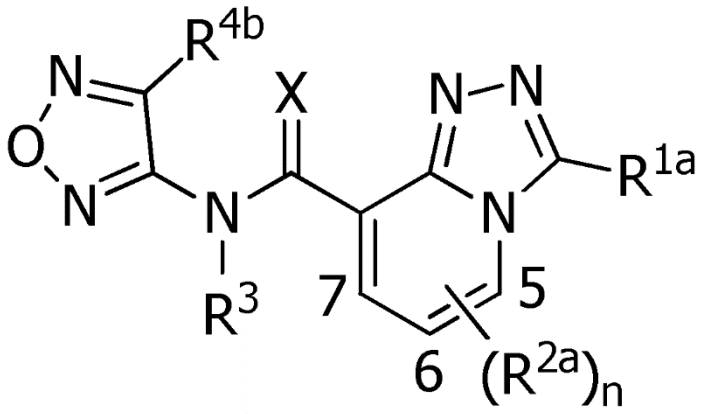
[Tabla 32]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{5a}	Punto de fusión (°C)
2-049	i-Pr	5-CF_2CF_3	O	H	Me	240-241
2-050	i-Pr	5-CF_3-6-Me	O	H	Me	208-209
2-051	NMe_2	5-CF_3	O	H	Me	222-225
2-052	CH(Me)SMe	5-CF_3	O	H	Me	202-204
2-053	CH(Me)S(O)Me	5-CF_3	O	H	Me	150-152
2-054	CH(Me)$S(O)_2$Me	5-CF_3	O	H	Me	117-125
2-055	i-Pr	5-Ph	O	H	Me	193-198
2-056	NHPh	5-CF_3	O	H	Me	255-260
2-057	$(CH_2)_2$SMe	5-CF_3	O	H	Me	144-146
2-058	$(CH_2)_2$S(O)Me	5-CF_3	O	H	Me	96-102
2-059	$(CH_2)_2S(O)_2$Me	5-CF_3	O	H	Me	173-175
2-060	D-8a	5-CF_3	O	H	Me	217-220
2-061	D-11	5-CF_3	O	H	Me	223-224
2-062	D-10a	5-CF_3	O	H	Me	246-248
2-063	3,5-$(MeO)_2$-Ph	5-CF_3	O	H	Me	197-199
2-064	3,5-$(Cl)_2$-Ph	5-CF_3	O	H	Me	269-271
2-065	CH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	167-168
2-066	NHCH$(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	104-107
2-067	S(O)Me	5-CF_3	O	H	Me	228-229
2-068	S$(CH_2)_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	136-138
2-069	S(O)$(CH_2)_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	155-157
2-070	$S(O)_2(CH_2)_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	203-205
2-071	$SCH_2CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	159-160
2-072	SCH$(CH_3)CH_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	170-173
2-073	i-Pr	5-CF_3	O	H	Ph	133-136
2-074	NH$(CH_2)_2$OMe	5-CF_3	O	H	Me	111-115
2-075	D-14	5-CF_3	O	H	Me	240-245
2-076	SCH_2Ph	5-CF_3	O	H	Me	179-181
2-077	SCH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	190-192
2-078	D-17	5-CF_3	O	H	Me	285-290
2-079	N(Me)$(CH_2)_2$OMe	5-CF_3	O	H	Me	168-169
2-080	NH$(CH_2)_2$SMe	5-CF_3	O	H	Me	*1
2-081	$NHCH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	*1
2-082	N(Me)CH$(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	171-172
2-083	N(Me)(c-Hex)	5-CF_3	O	H	Me	144-145
2-084	SCH_2(c-Pr)	5-CF_3	O	H	Me	168-169
2-085	SCH_2(D-15)	5-CF_3	O	H	Me	139-141
2-086	SCH_2CN	5-CF_3	O	H	Me	144-145
2-087	SCH_2CF_3	5-CF_3	O	H	Me	160-161
2-088	N(Me)Et	5-CF_3	O	H	Me	110-112
2-089	$N(Et)_2$	5-CF_3	O	H	Me	159-160
2-090	i-Pr	5-CF_3	O	H	n-Pr	111-112
2-091	i-Pr	5-CF_3	O	H	$CH_2CH=CH_2$	118-119
2-092	i-Pr	5-CF_3	O	H	$CH_2C(O)OEt$	104-105
2-093	i-Pr	5-CF_3	O	H	CH_2(4-Cl-Ph)	147-148
2-094	N(Me)$CH_2C\equiv CH$	5-CF_3	O	H	Me	176-178
2-095	N(Me)$(CH_2)_2CN$	5-CF_3	O	H	Me	125-128
2-096	S(c-Pen)	5-CF_3	O	H	Me	192-194

[Tabla 33]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{5a}	Punto de fusión (°C)
2-097	SCH_2(D-8a)	5-CF_3	O	H	Me	175-178
2-098	SEt	5-CF_3	O	H	CH_2CH_2OMe	130-131
2-099	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	141-142
2-100	N(Me)$CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	183-184
2-101	S$(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	144-145
2-102	$SCH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	172-174
2-103	$SCH_2C\equiv CH$	5-CF_3	O	H	Me	190-191
2-104	i-Pr	5-CF_3	O	H	H	276-280
2-105	$CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	164-167(*5)
2-105*	CH=CHMe	5-CF_3	O	H	Me	164-167(*5)
2-106	$C\equiv CMe$	5-CF_3	O	H	Me	244-246
2-107	$CH_2OC(O)Me$	5-CF_3	O	H	Me	176-178
2-108	CH_2OH	5-CF_3	O	H	Me	155-158
2-109	CHO	5-CF_3	O	H	Me	250-252
2-110	D-16a	5-CF_3	O	H	Me	194-201

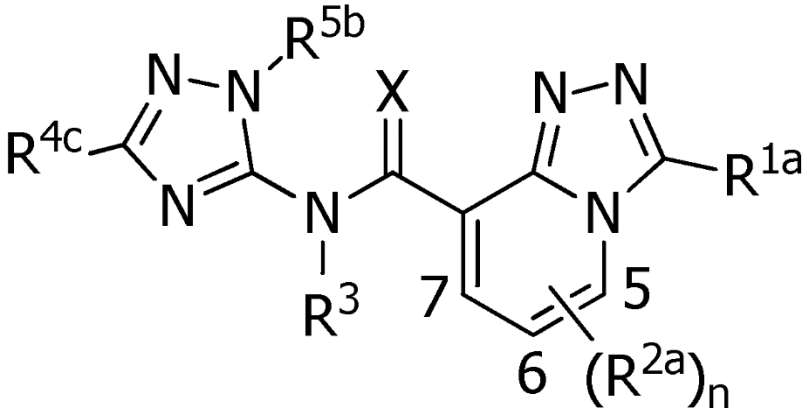
[0251] [Sexta Tabla]



[Tabla 34]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{4b}	Punto de fusión (°C)
3-001	i-Pr	5-CF_3	O	H	Me	185-186
3-002	$SCH_2CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	136-137

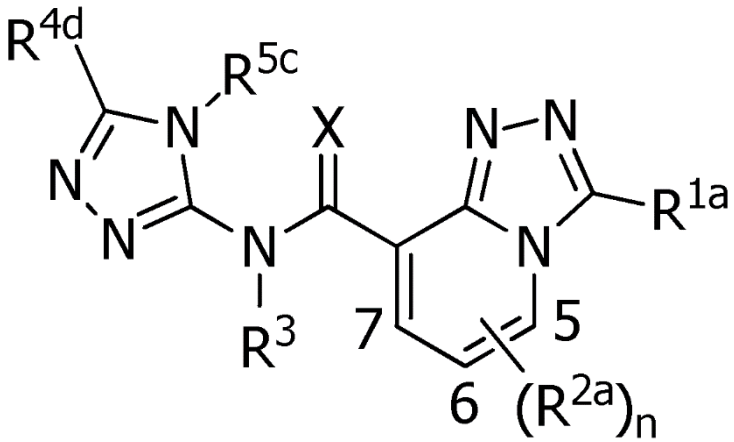
[0252] [Séptima Tabla]



[Tabla 35]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{4c}	R^{5b}	Punto de fusión (°C)
4-001	i-Pr	5-CF_3	O	H	H	Me	182-185
4-002	i-Pr	5-CF_3	O	H	H	Et	*1
4-003	SEt	5-CF_3	O	H	H	Me	119-120
4-004	i-Pr	5-CF_3	O	H	H	H	250-255

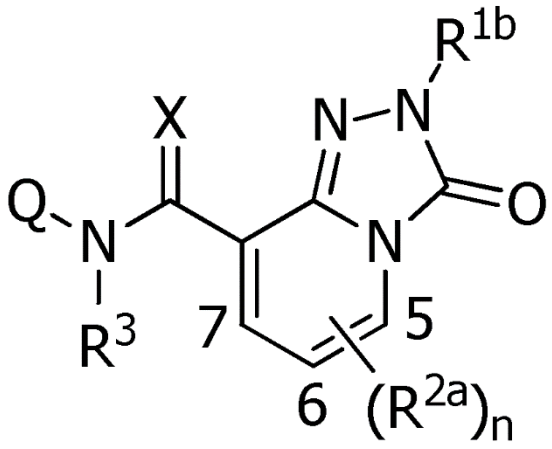
[0253] [Octava Tabla]



[Tabla 36]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{4d}	R^{5c}	Punto de fusión (°C)
5-001	i-Pr	5-CF_3	O	H	Me	Me	215-220
5-002	i-Pr	5-CF_3	O	H	-CH=CH-CH=CH-		219-223
5-003	i-Pr	5-CF_3	O	H	-$(CH_2)_4$-		130-135

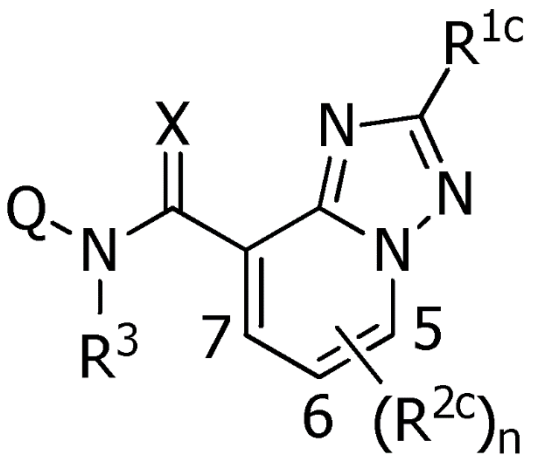
[0254] [Novena Tabla]



[Tabla 37]

No.	Q	R^{1b}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	Punto de Fusión (°C)
6-001	D-6a	Me	5-CF_3	O	H	250-260
6-002	D-7a	Me	5-CF_3	O	H	245-246
6-003	D-6a	Et	5-CF_3	O	H	234-236
6-004	D-7a	Et	5-CF_3	O	H	176-178
6-005	D-6a	i-Pr	5-CF_3	O	H	184-190
6-006	D-6a	CH_2Ph	5-CF_3	O	H	155-162
6-007	D-20a	Et	5-CF_3	O	H	182-185
6-008	D-23a	Et	5-CF_3	O	H	162-164

[0255] [Décima Tabla]



[Tabla 38]

No.	Q	R^{1c}	$(R^{2c})_n$	X	R^3	Punto de fusión (°C)
7-001	D-6a	i-Pr	5-CF_3	O	H	252-255
7-002	D-7a	i-Pr	5-CF_3	O	H	168-170

Entre los compuestos de la presente invención, los datos de 1H-NMR de los compuestos que no tienen punto de fusión y las mezclas de isómeros de "*3", "*4", y "*5" se encuentran en la undécima tabla.

Los valores del cambio químico de la resonancia magnética nuclear del protón fueron medidos en solvente deuterado de cloroformo a 300MHZ usando Me_4Si (tetrametilsilano) como patrón. Los símbolos en la cuarta tabla tienen los siguientes significados s: singulete, Bfs: singulete ancho, d: doblete, dd: doble doblete, t: triplete, q: cuarteto, y m: multiplete.

Undécima Tabla

[Tabla 39]

No.	^{1}H-NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz)
1-003	δ 8.21 (d, 1H, J=7.2Hz), 6.77 (d, 1H, J=7.2Hz), 3.85-3.70 (m, 1H), 2.97 (s, 3H), 2.55 (s, 3H), 1.58 (d, 6H, J=7.2Hz)。
1-009	δ 8.24 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.67 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.92 (brs, 1H), 4.25-4.10 (m, 1H), 2.75 (s, 3H), 2.55 (s, 3H), 1.60 (d, 6H, J=6.9Hz)。
1-037	δ 8.51 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.72 (d, 1H, J=6.9Hz), 5.05 (s, 2H), 3.26 (s, 3H), 2.60 (s, 3H)。(No se observa el pico del proton de CONH)
1-039	δ 8.54 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.76 (d, 1H, J=7.5Hz), 5.17 (s, 2H), 4.36 (q, 2H, J=9.0Hz), 2.60 (s, 3H)。(No se observa el pico del proton de CONH)
1-040	δ 8.54 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.79 (d, 1H, J=7.2Hz), 3.78 (s, 3H), 2.60 (s, 3H)。(No se observa el pico del proton de CONH)
1-041	δ 8.53 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.78 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.00 (q, 2H, J=7.5Hz), 2.60 (s, 3H), 1.59(t, 3H, J=7.5Hz)。(No se observa el pico del proton de CONH)
1-098	δ 8.34 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.59 (d, 1H, J=7.5Hz), 3.82 (t, 4H, J=4.9Hz), 3.79-3.68 (m, 1H), 3.54 (t, 4H, J=4.9Hz), 1.56(d, 6H, J=6.5Hz)。 (No se observa el pico del proton de CONH)
1-118	δ 12.68 (brs, 1H), 8.39 (d, 1H, J=7.4Hz), 7.59 (d, 1H, J=7.4Hz), 3.59 -3.39 (m, 4H), 3.05-2.78 (m, 4H), 2.59 (s, 3H)。
1-158	δ 13.1 (brs, 1H), 8.44 (d, 1H, J=7.5Hz), 8.30 (s, 1H), 7.64 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.38-6.25 (m, 1H), 5.38-5.24 (m, 2H), 4.04 (dd, 2H, J=3.9Hz, 1.2Hz)。
1-158*	δ 13.0 (brs, 1H), 8.43 (d, 1H, J=6.6Hz), 8.30 (s, 1H), 7.62 (d, 1H, J=6.6Hz), 7.11-7.01 (m, 1H), 6.71-6.61(m, 1H), 2.10 (d, 3H, J=6.6Hz)。
1-159	δ 12.9 (brs, 1H), 8.42 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.63 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.38-6.24 (m, 1H), 5.36-5.23 (m, 2H), 4.03 (dd, 2H, J=6.9Hz, 1.2Hz), 2.59 (s, 3H)。
1-159*	δ 12.9 (brs, 1H), 8.38 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.60 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.12-7.00 (m, 1H), 6.69-6.62 (m, 1H), 2.60 (s, 3H), 2.09 (dd, 3H, J=6.6Hz, 1.8Hz)。
1-160	δ 12.8 (brs, 1H), 8.46 (d, 1H, J=7.2Hz), 8.31 (s, 1H), 7.65 (d, 1H, J=7.2Hz), 2.27 (s, 3H)。
1-161	δ 12.6 (brs, 1H), 8.44 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.64 (d, 1H, J=7.2Hz), 2.59 (s, 3H), 2.27 (s, 3H)。
1-174	δ 7.72 (d, 1H, J=7.8Hz), 7.53 (d, 1H, J=7.8Hz), 4.15 (q, 2H, J=7.2Hz), 2.78 (d, 1H, J=7.8Hz), 2.38 (s, 3H), 1.83 (d, 1H, J=7.8Hz), 1.80 (s, 3H), 1.43 (t, 3H, J=7.2Hz)。
2-037	δ 12.08 (brs, 1H), 8.62 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.86 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.12 (s, 3H), 3.80 (s, 3H)。
2-038	δ 12.11 (brs, 1H), 8.62 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.86 (d, 1H, J=7.2Hz), 4.12 (s, 3H), 4.01 (q, 2H, J=7.2Hz), 1.60 (t, 3H, J=7.2Hz)。
2-041	δ 12.49 (brs, 1H), 8.35 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.62 (d, 1H, 7.5Hz), 4.65-4.55 (m, 2H), 3.90-3.80 (m, 2H), 3.75-3.65 (m, 1H), 3.38 (s, 3H), 1.60-1.50(m, 6H)。

[Tabla 40]

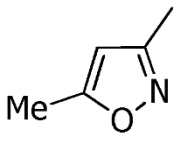
No.	^{1}H-NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz)
2-048	δ 12.6 (brs, 1H), 8.35 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.64 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.60 (t, 2H, J=7.2Hz), 3.80-3.65 (m, 1H), 3.09 (t, 2H, J=7.2Hz), 2.11 (s, 3H), 1.56 (d, 6H, J=6.9Hz)。
2-080	δ 12.4 (brs, 1H), 8.14 (d, 1H, J=6.6Hz), 7.40 (d, 1H, J=6.6Hz), 5.24 (brs, 1H), 4.11 (s, 3H), 3.88-3.80 (m, 2H), 2.99-2.91 (m, 2H), 2.16 (s, 3H)。
2-081	δ 12.3 (brs, 1H), 8.23 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.49 (d, 1H, J=7.2Hz), 4.78 (brs, 1H), 4.45-4.32 (m, 2H), 4.11 (s, 3H)。
2-105	δ 12.5 (brs, 1H), 8.40 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.65 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.37-6.24 (m, 1H), 5.37-5.24 (m, 2H), 4.13 (s, 3H), 4.06 (dd, 2H, J=6.6Hz, 1.2Hz)。
2-105*	δ 12.5 (brs, 1H),8.36 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.62 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.13-7.01 (m, 1H), 6.70-6.62 (m, 1H), 4.13 (s, 3H), 2.10 (dd, 3H, J=6.6Hz, 1.5Hz)。
4-002	δ 12.3(brs, 1H), 8.37 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.88(s, 1H), 7.61 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.23 (q, 2H, J=7.5Hz), 3.80-3.60 (m, 1H), 1.60-1.50 (m, 9H)。

[0258] Ejemplo de Referencia

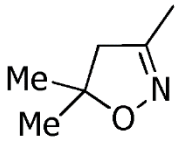
[Ejemplo de Referencia 1]

Los compuestos listados en la duodécima table fueron sintetizados mediante un método similar al método del paso 1 del ejemplo de síntesis 7. En las Tablas, Me es un grupo metilo. similarmente, Et es un grupo etilo, Pr es un grupo propilo, Pen es un grupo pentilo, Ph es un grupo fenilo, Bn es un grupo bencilo, n- es normal, i- es iso, c- es ciclo, y t- es terciario.

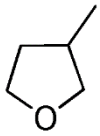
En las tablas, los sustituyentes de D-3a, D-4a, D-5, D-8a, D-9a, D-10a, D-11, D-12, D-13a, D-14, D-16a, y D-16m tiene las siguientes estructuras.



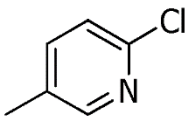
D-3a



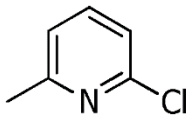
D-4a



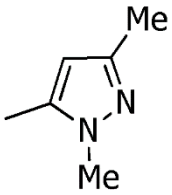
D-5



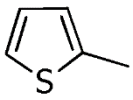
D-8a



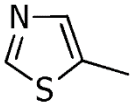
D-9a



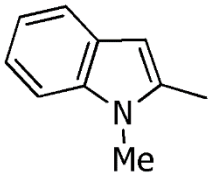
D-10a



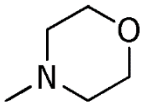
D-11



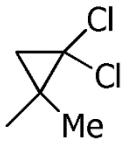
D-12



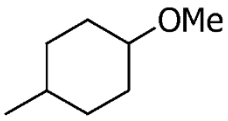
D-13a



D-14



D-16a

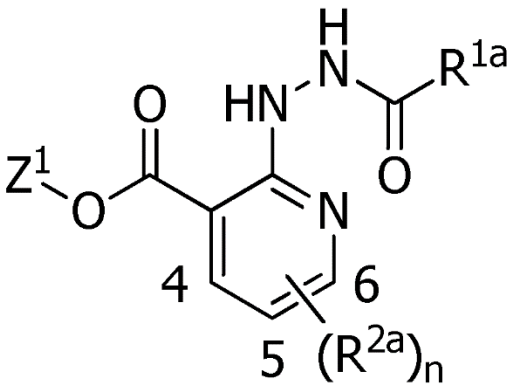


D-16m

[0259] Entre los compuestos de la presente invención, los datos de 1H-NMR de los compuestos que no tienen punto de fusión se encuentran en la decimosexta tabla.

Los valores del cambio químico de la resonancia magnética nuclear del protón fueron medidos en solvente deuterado de cloroformo a 300MHZ usando Me_4Si (tetrametilsilano) como patrón. Los símbolos en la cuarta tabla tienen los siguientes significados s: singulete, Bfs: singulete ancho, d: doblete, dd: doble doblete, t: triplete, q: cuarteto, y m: multiplete.

[0260] [Duodécima Tabla]



[Tabla 41]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})n$	Z^1	Punto de Fusión (°C)
A1-01a	H	6-CF_3	Me	*1
A1-02a	c-Pr	6-CF_3	Me	143-144
A1-03a	3-Pen	6-CF_3	Me	125-126
A1-04a	Ph	6-CF_3	Me	*1
A1-05a	CH_2OMe	6-CF_3	Me	76－77
A1-06a	4-MeO-Ph	6-CF_3	Me	116-120
A1-07a	4-Cl-Ph	6-CF_3	Me	163-165
A1-08a	$CH_2O(CH_2)_2OMe$	6-CF_3	Me	*1
A1-09a	$CH_2OCH_2CF_3$	6-CF_3	Me	82-85
A1-10a	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	6-CF_3	Me	148-149
A1-11a	D-3a	6-CF_3	Me	121-122
A1-12a	i-Pr	5-CF_3	Me	130-131
A1-13a	n-Pr	6-CF_3	Me	119-120
A1-14a	CH_2OPh	6-CF_3	Me	95-97
A1-15a	c-Pen	6-CF_3	Me	158-159
A1-16a	D-5	6-CF_3	Me	155-156
A1-17a	CH_2OEt	6-CF_3	Me	55-57
A1-18a	t-Bu	6-CF_3	Me	144-146
A1-19a	D-4a	6-CF_3	Me	99-100
A1-20a	CH_2SMe	6-CF_3	Me	127-129
A1-21a	$CH_2SCH_2CF_3$	6-CF_3	Me	114-116
A1-22b	$CH_2C(O)OEt$	6-CF_3	Bn	110-112
A1-23a	4-Me-Ph	6-CF_3	Me	183-185
A1-24a	4-F-Ph	6-CF_3	Me	117-119
A1-25a	4-CF_3-Ph	6-CF_3	Me	160-162
A1-26a	3-MeO-Ph	6-CF_3	Me	103-106
A1-27a	2-MeO-Ph	6-CF_3	Me	160-164
A1-28a	i-Pr	6-CF_2H	Me	140-141
A1-29a	D-8a	6-CF_3	Me	172-175
A1-30a	D-9a	6-CF_3	Me	160-170
A1-31a	D-10a	6-CF_3	Me	161-163
A1-32a	D-11	6-CF_3	Me	45-50
A1-33a	D-12	6-CF_3	Me	40-45
A1-34a	D-13a	6-CF_3	Me	183-184
A1-35b	$CH_2OC(O)Me$	6-CF_3	Bn	89-91
A1-36a	CH_2(4-MeO-Ph)	6-CF_3	Me	121-122
A1-37c	i-Pr	6-CF_2CF_3	Et	120-121
A1-38a	3,5-$(MeO)_2$-Ph	6-CF_3	Me	106-107
A1-39a	3,5-$(Cl)_2$-Ph	6-CF_3	Me	178-179
A1-40a	i-Pr	5-Me-6-CF_3	Me	169-174
A1-41c	i-Pr	4-Me-6-CF_3	Et	140-141
A1-42a	$(CH_2)_2SMe$	6-CF_3	Me	90-91
A1-43a	CH(Me)SMe	6-CF_3	Me	166-167
A1-44c	i-Pr	6-Ph	Et	144-146
A1-45c	i-Pr	6-{3,5-$(F)_2$-Ph}	Et	144-146
A1-46a	NMe_2	6-CF_3	Me	134-137
A1-47c	D-14	6-CF_3	Et	101-105
A1-48a	CH_2(c-Pr)	6-CF_3	Me	119-122

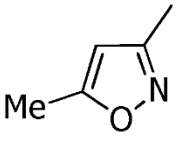
[Tabla 42]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})n$	Z^1	Punto de Fusión (°C)
A1-49a	D-16a	6-CF_3	Me	70-75
A1-50a	C≡CMe	6-CF_3	Me	151-153
A1-51a	CH_2CF_3	6-CF_3	Me	170-172
A1-52a	CH_2CN	6-CF_3	Me	163-165
A1-53c	D-16m	6-CF_3	Et	120-125
A1-55c	$(CH_2)_2OMe$	6-CF_3	Et	96-98

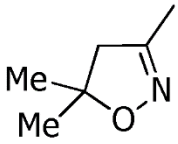
[0261] [Ejemplo de Referencia 2]

Los compuestos listados en la decimotercera table fueron sintetizados mediante un método similar al método del paso 2 del ejemplo de síntesis 7. En las Tablas, Me es un grupo metilo. Similarmente, Et es un grupo etilo, Pr es un grupo propilo, Pen es un grupo pentilo, Ph es un grupo fenilo, Bn es un grupo bencilo, n- es normal, i- es iso, c- es ciclo, y t- es terciario.

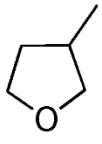
EN las tablas, los sustituyentes de D-3a, D-4a, D-5, D-8a, D-9a, D-10a, D-11, D-12, D-13a, D-14, D-16a, D-16m y D-24f tienen las siguietes estructuras.



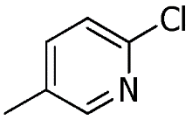
D-3a



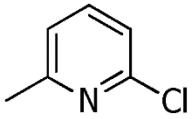
D-4a



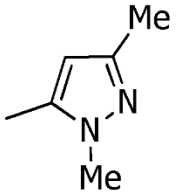
D-5



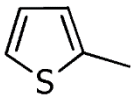
D-8a



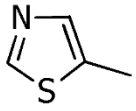
D-9a



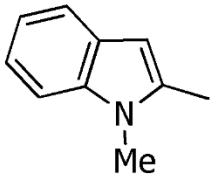
D-10a



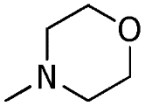
D-11



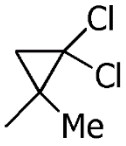
D-12



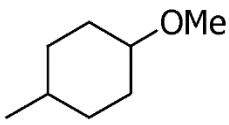
D-13a



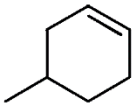
D-14



D-16a

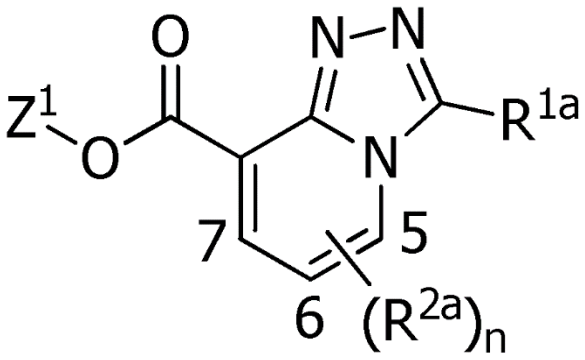


D-16m


D-24f

[0262] En las Tablas, "*1" es "Resinoso". Los datos de ^{1}H-NMR de los compuestos que no tienen punto de fusión están registrados en la decimosexta tabla.

[0263] [Decimotercera Tabla]



[Tabla 43]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})n$	Z^1	Punto de Fusión (°C)
B1-01a	H	5-CF_3	Me	*1
B1-02a	c-Pr	5-CF_3	Me	*1
B1-04a	Ph	5-CF_3	Me	*1
B1-05a	CH_2OMe	5-CF_3	Me	95－97
B1-06a	4-MeO-Ph	5-CF_3	Me	160-162
B1-07a	4-Cl-Ph	5-CF_3	Me	148-152
B1-08a	$CH_2O(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	Me	*1
B1-09a	$CH_2OCH_2CF_3$	5-CF_3	Me	87-89
B1-10a	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	5-CF_3	Me	86-94
B1-11a	D-3a	5-CF_3	Me	140-141
B1-12a	i-Pr	6-CF_3	Me	105-107
B1-13a	n-Pr	5-CF_3	Me	129-130
B1-14a	CH_2OPh	5-CF_3	Me	102-103
B1-15a	c-Pen	5-CF_3	Me	130-134
B1-17a	CH_2OEt	5-CF_3	Me	87-89
B1-18a	t-Bu	5-CF_3	Me	75-77
B1-19a	D-4a	5-CF_3	Me	137-139
B1-20a	CH_2SMe	5-CF_3	Me	97-99
B1-21a	$CH_2SCH_2CF_3$	5-CF_3	Me	125-126
B1-22b	$CH_2C(O)OEt$	5-CF_3	Bn	72-73
B1-23a	4-Me-Ph	5-CF_3	Me	142-145
B1-24a	4-F-Ph	5-CF_3	Me	133-135
B1-25a	4-CF_3-Ph	5-CF_3	Me	170-171
B1-26a	3-MeO-Ph	5-CF_3	Me	135-142
B1-27a	2-MeO-Ph	5-CF_3	Me	*1
B1-28a	i-Pr	5-CF_2H	Me	142-145
B1-29a	D-8a	5-CF_3	Me	*1
B1-30a	D-9a	5-CF_3	Me	140-145
B1-31a	D-10a	5-CF_3	Me	126-129
B1-32a	D-11	5-CF_3	Me	122-124
B1-33a	D-12	5-CF_3	Me	171-172
B1-34a	D-13a	5-CF_3	Me	*1
B1-35b	$CH_2OC(O)Me$	5-CF_3	Bn	88-89
B1-36a	CH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	Me	92-110
B1-37c	i-Pr	5-CF_2CF_3	Et	57-58
B1-38a	3,5-$(MeO)_2$-Ph	5-CF_3	Me	150-161
B1-39a	3,5-$(Cl)_2$-Ph	5-CF_3	Me	157-164
B1-40a	i-Pr	5-CF_3-6-Me	Me	58-59
B1-41c	i-Pr	5-CF_3-7-Me	Et	76-77
B1-42a	$(CH_2)_2SMe$	5-CF_3	Me	126-127
B1-43a	CH(Me)SMe	5-CF_3	Me	103-104
B1-44c	i-Pr	5-Ph	Et	133-134
B1-45c	i-Pr	5-{3,5-$(F)_2$-Ph}	Et	125-127
B1-46a	NMe_2	5-CF_3	Me	135-137
B1-47c	D-14	5-CF_3	Et	138-139
B1-48a	CH_2(c-Pr)	5-CF_3	Me	130-135
B1-49a	D-16a	5-CF_3	Me	*1
B1-50a	C≡CMe	5-CF_3	Me	163-168

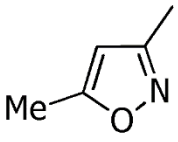
[Tabla 44]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})n$	Z^1	Punto de Fusión (°C)
B1-51a	CH_2CF_3	5-CF_3	Me	150-154
B1-52a	CH_2CN	5-CF_3	Me	165-170
B1-53c	D-16m	5-CF_3	Et	95-102
B1-54c	D-24f	5-CF_3	Et	101-110
B1-55c	$(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	Et	82-83

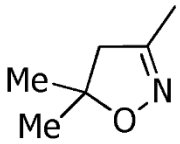
[0264] [Ejemplo de referencia 3]

Los compuestos listados en la decimocuarta table fueron sintetizados mediante un método similar al método del paso 2 del ejemplo de síntesis 7. En las Tablas, Me es un grupo metilo. Similarmente, Et es un grupo etilo, Pr es un grupo propilo, Pen es un grupo pentilo, Ph es un grupo fenilo, Bn es un grupo bencilo, n- es normal, i- es iso, c- es ciclo, y t- es terciario.

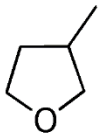
En las tablas, los sustituyentes de D-3a, D-4a, D-5, D-8a, D-9a, D-10a, D-11, D-12, D-13a, D-14, D-16a, D-16m y D-24f tienen las siguientes estructuras.



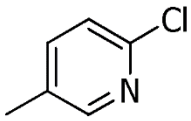
D-3a



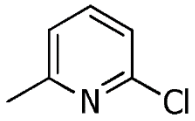
D-4a



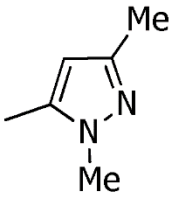
D-5



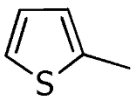
D-8a



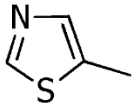
D-9a



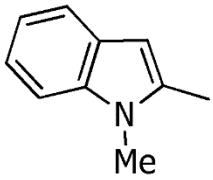
D-10a



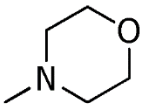
D-11



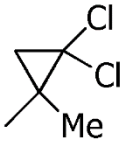
D-12



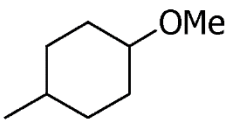
D-13a



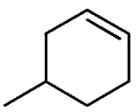
D-14



D-16a

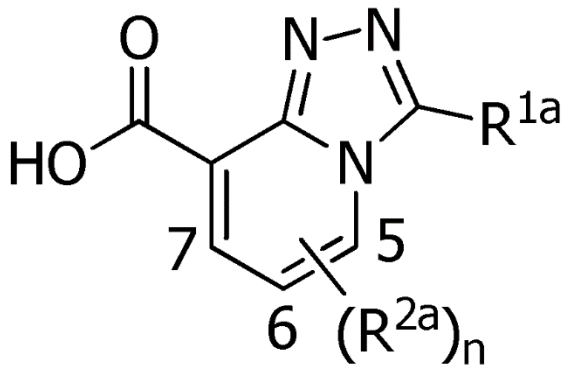


D-16m


D-24f

[0265] En las Tablas, "*1" es "Resinoso". Los datos de ^{1}H-NMR de los compuestos que no tiene puntos de fusión se encuentran en la Décimosexta Tabla.

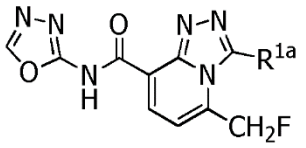
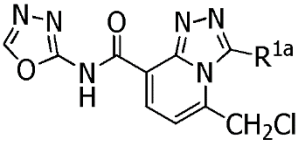
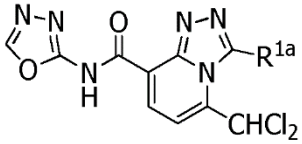
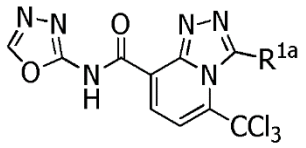
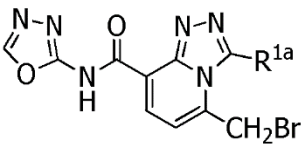
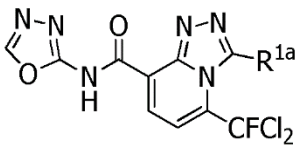
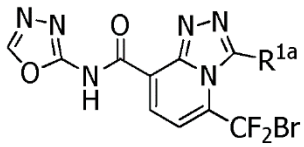
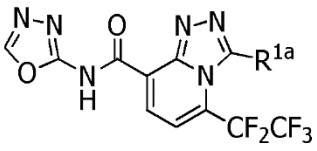
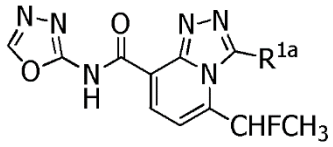
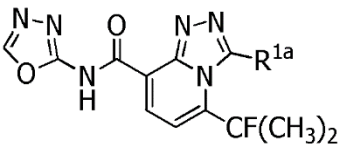
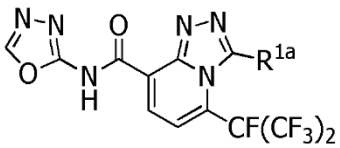
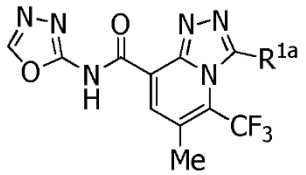
[0266] [Decimocuarta Tabla]

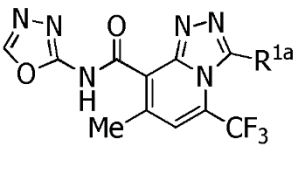
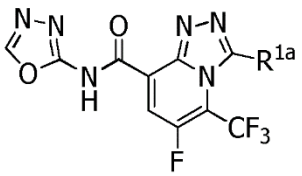
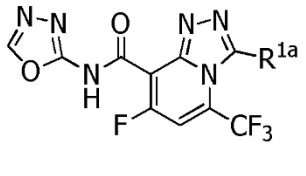
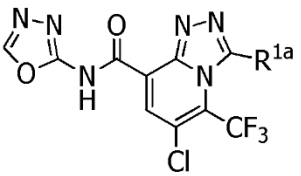
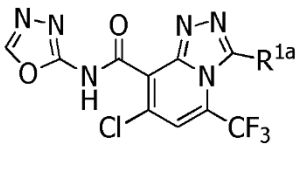


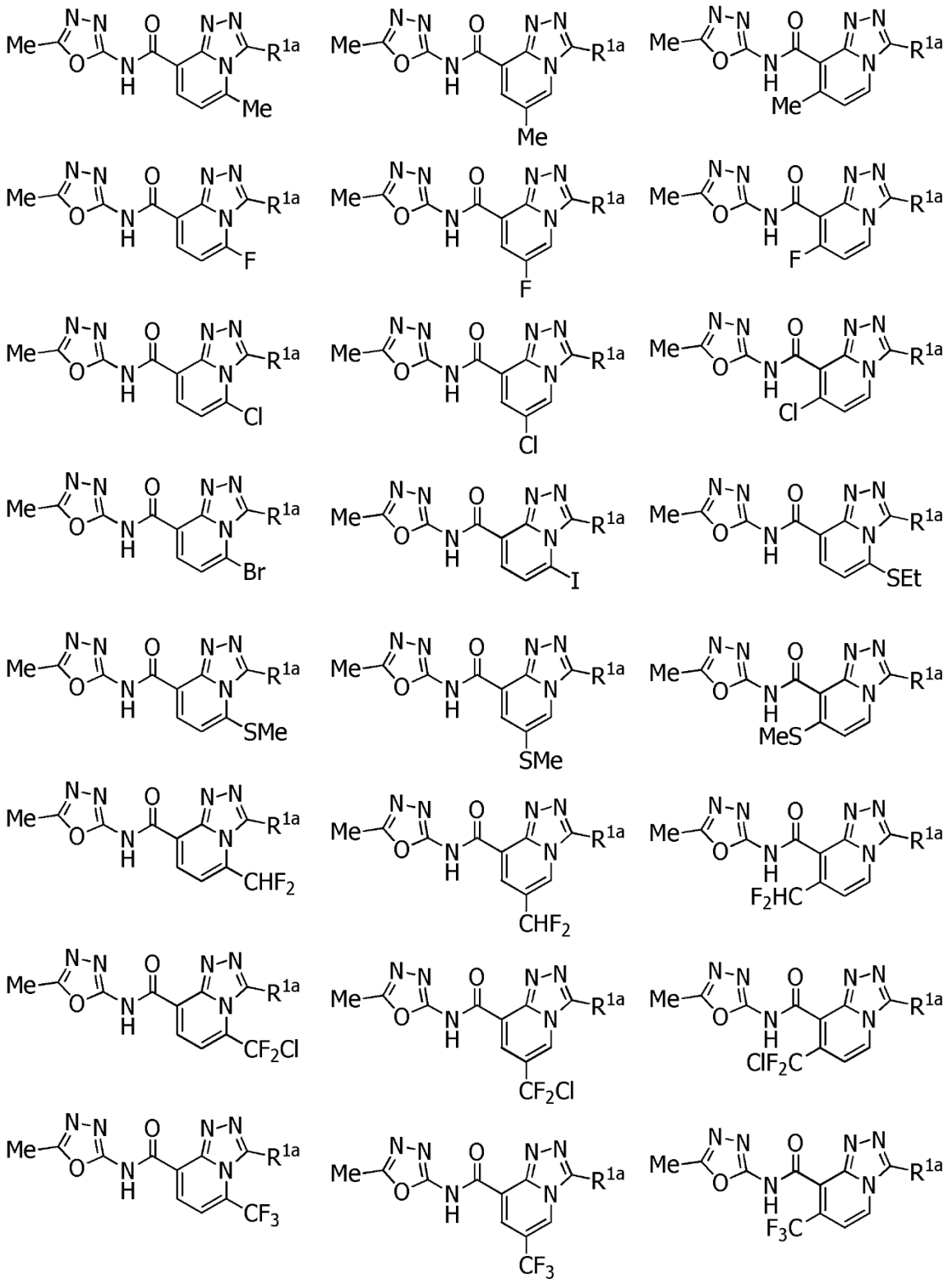
[Tabla 45]

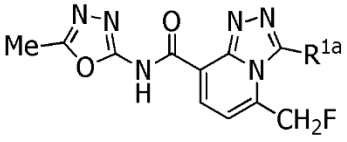
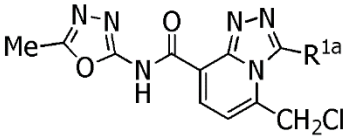
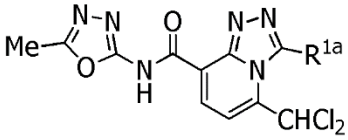
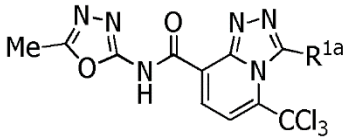
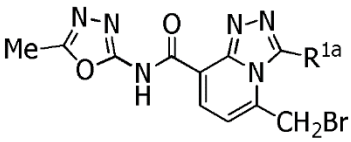
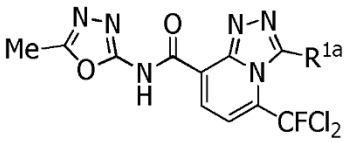
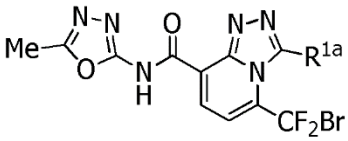
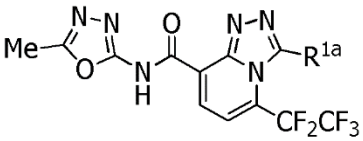
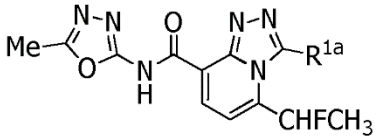
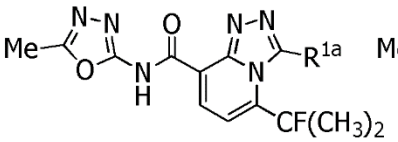
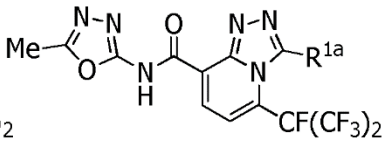
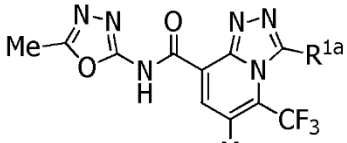
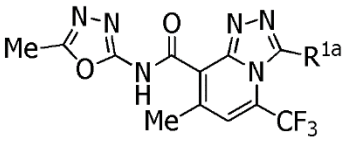
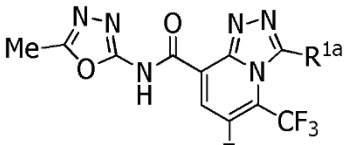
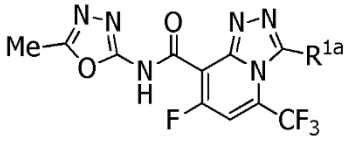
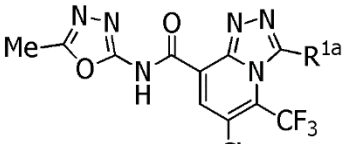
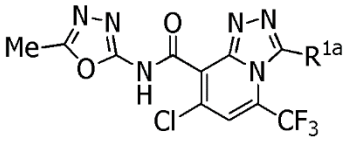
No.	R^{1a}	$(R^{2a})n$	Punto de Fusión (°C)
C1-01	H	5-CF_3	*1
C1-02	c-Pr	5-CF_3	*1
C1-03	3-Pen	5-CF_3	137-139
C1-04	Ph	5-CF_3	*1
C1-05	CH_2OMe	5-CF_3	111－112
C1-06	4-MeO-Ph	5-CF_3	215-218
C1-07	4-Cl-Ph	5-CF_3	241-247
C1-08	$CH_2O(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	47-49
C1-09	$CH_2OCH_2CF_3$	5-CF_3	67-70
C1-10	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	5-CF_3	137-140
C1-11	D-3a	5-CF_3	197-201
C1-12	i-Pr	6-CF_3	224-226
C1-13	n-Pr	5-CF_3	134-135
C1-14	CH_2OPh	5-CF_3	136-140
C1-15	c-Pen	5-CF_3	156-158
C1-16	D-5	5-CF_3	195-200
C1-17	CH_2OEt	5-CF_3	96-97
C1-18	t-Bu	5-CF_3	125-131
C1-19	D-4a	5-CF_3	184-186
C1-20	CH_2SMe	5-CF_3	110-111
C1-21	$CH_2SCH_2CF_3$	5-CF_3	56-59
C1-22	$CH_2C(O)OEt$	5-CF_3	124-126
C1-23	4-Me-Ph	5-CF_3	250-253
C1-24	4-F-Ph	5-CF_3	249-251
C1-25	4-CF_3-Ph	5-CF_3	199-201
C1-26	3-MeO-Ph	5-CF_3	179-181
C1-27	2-MeO-Ph	5-CF_3	85-90
C1-28	i-Pr	5-CF_2H	193-195
C1-29	D-8a	5-CF_3	237-240
C1-30	D-9a	5-CF_3	231-234
C1-31	D-10a	5-CF_3	215-220
C1-32	D-11	5-CF_3	190-195
C1-33	D-12	5-CF_3	218-223
C1-34	D-13a	5-CF_3	185-188
C1-35	$CH_2OC(O)Me$	5-CF_3	126-128
C1-36	CH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	73-75
C1-37	i-Pr	5-CF_2CF_3	170-175
C1-38	3,5-$(MeO)_2$-Ph	5-CF_3	158-160
C1-39	3,5-$(Cl)_2$-Ph	5-CF_3	250-252
C1-40	i-Pr	5-CF_3-6-Me	153-154
C1-41	i-Pr	5-CF_3-7-Me	190-192
C1-42	$(CH_2)_2SMe$	5-CF_3	149-151
C1-43	CH(Me)SMe	5-CF_3	145-146
C1-44	i-Pr	5-Ph	218-219
C1-45	i-Pr	5-{3,5-$(F)_2$-Ph}	210-220
C1-46	NMe_2	5-CF_3	181-183
C1-47	D-14	5-CF_3	210-213
C1-48	CH_2(c-Pr)	5-CF_3	109-114

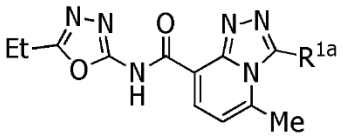
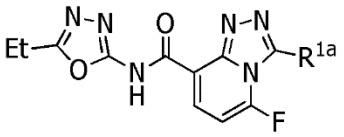
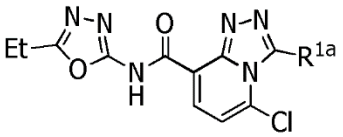
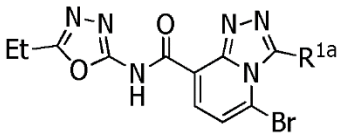
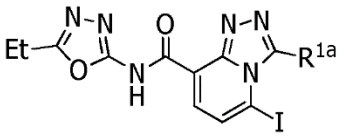
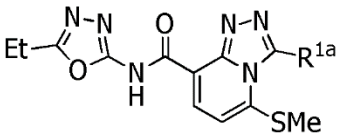
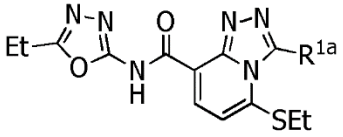
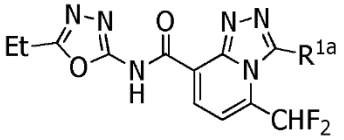
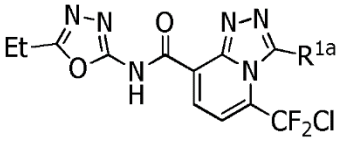
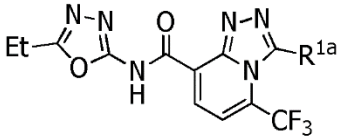
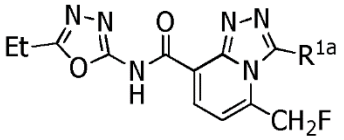
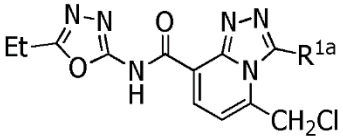
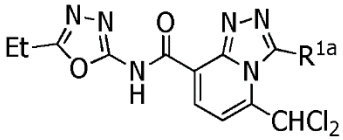
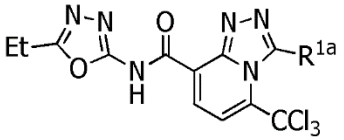
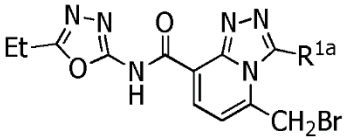
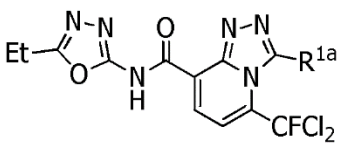
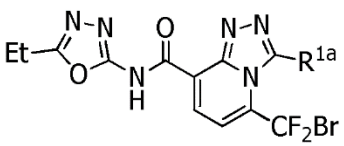
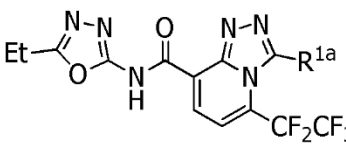
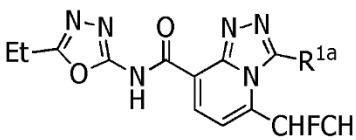
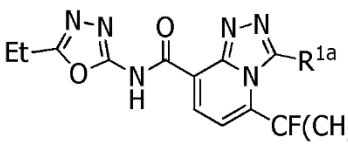
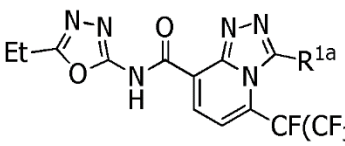
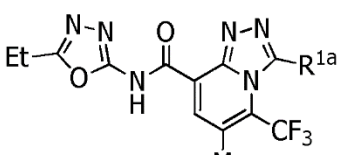
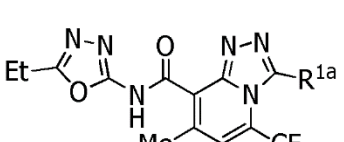
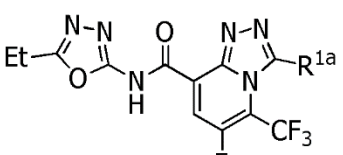
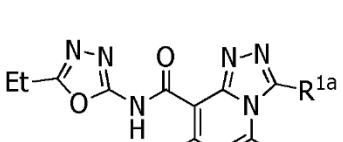
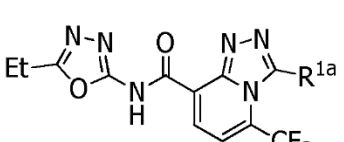
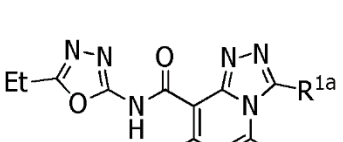
[Tabla 46]

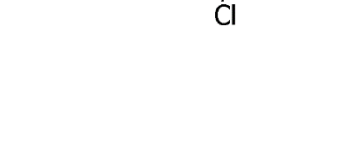













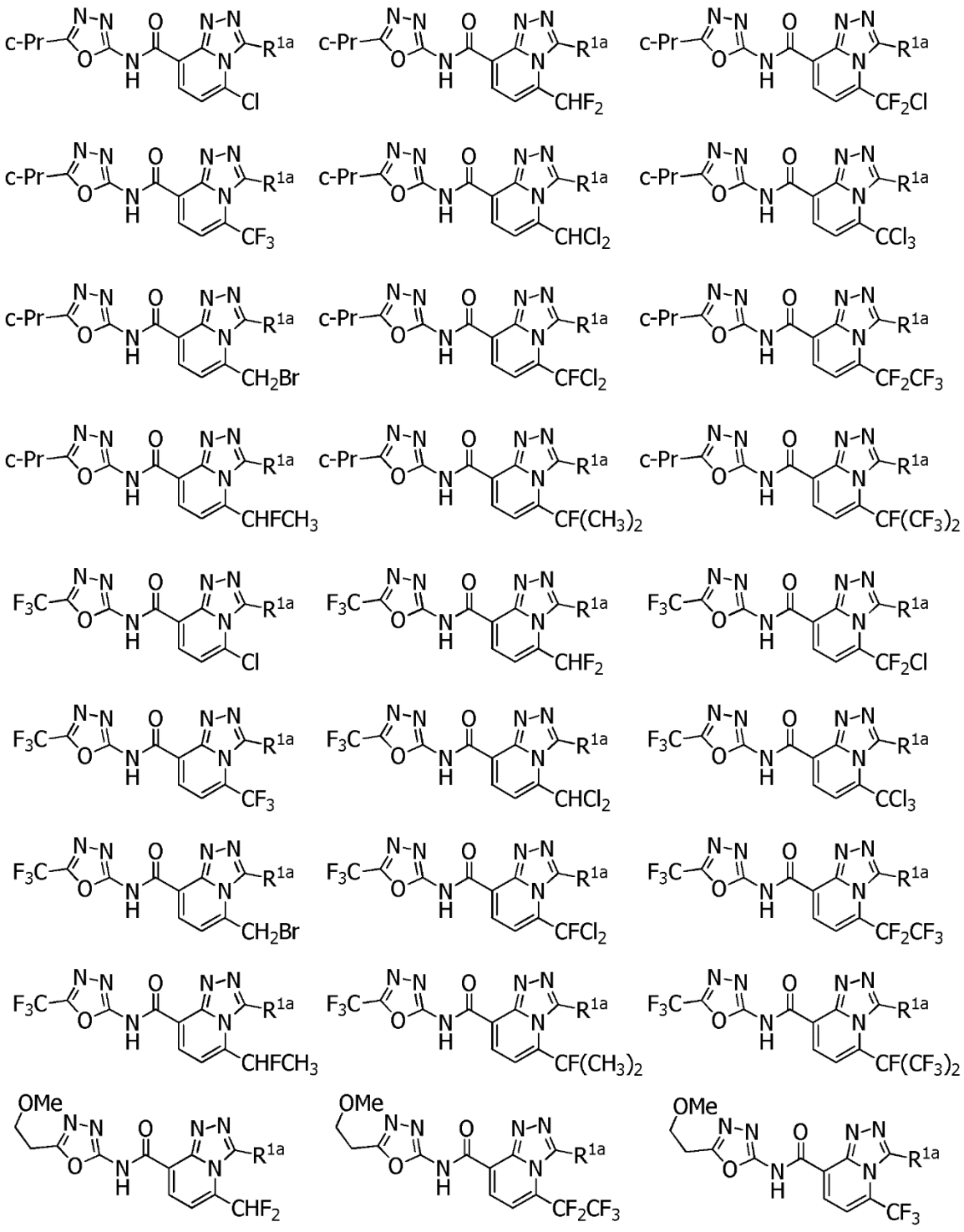






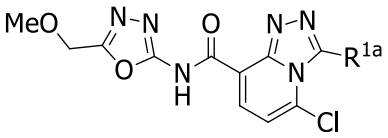
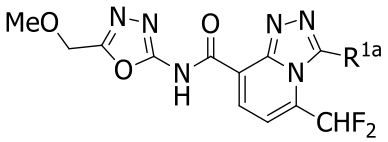
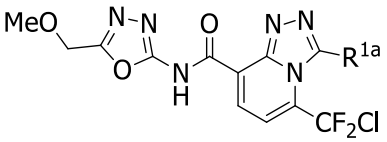
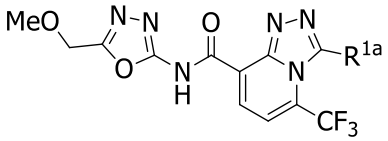
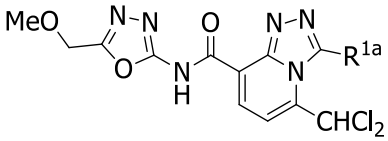
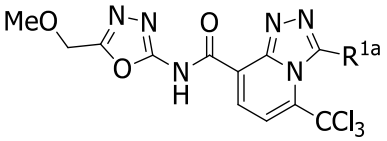
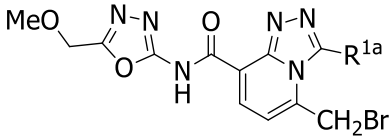
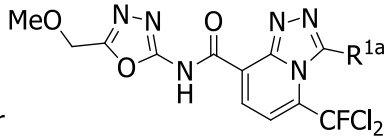
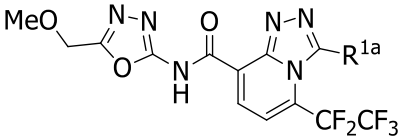
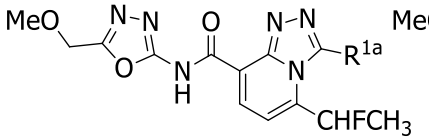
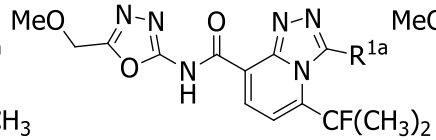
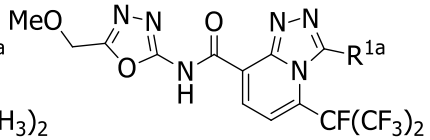
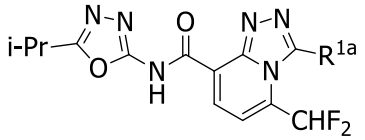
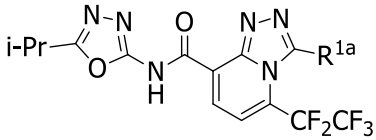
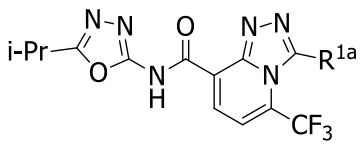
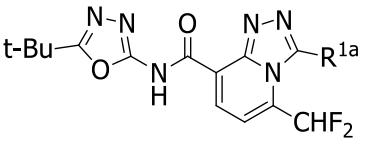
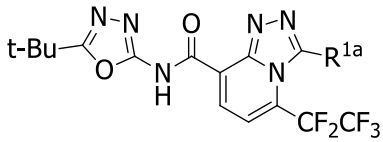
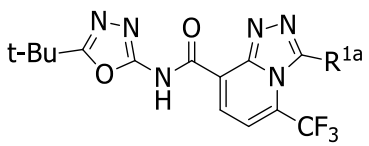
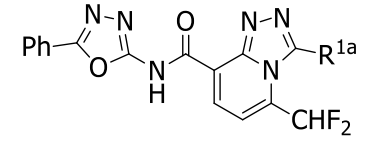
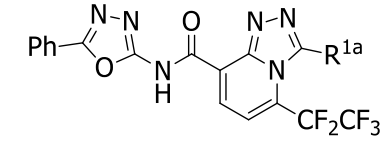
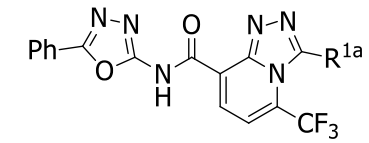
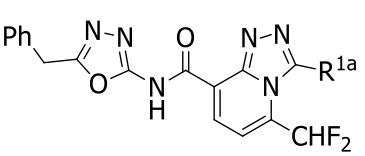
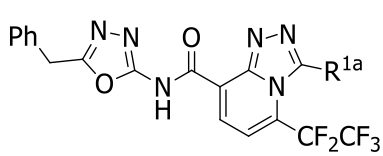
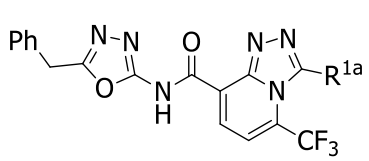
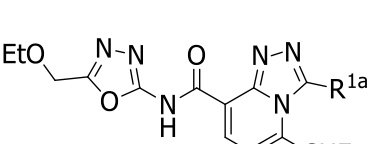
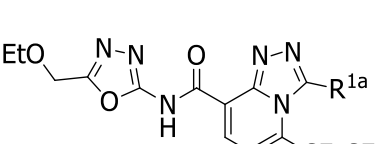
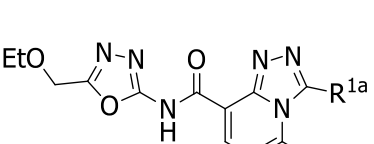


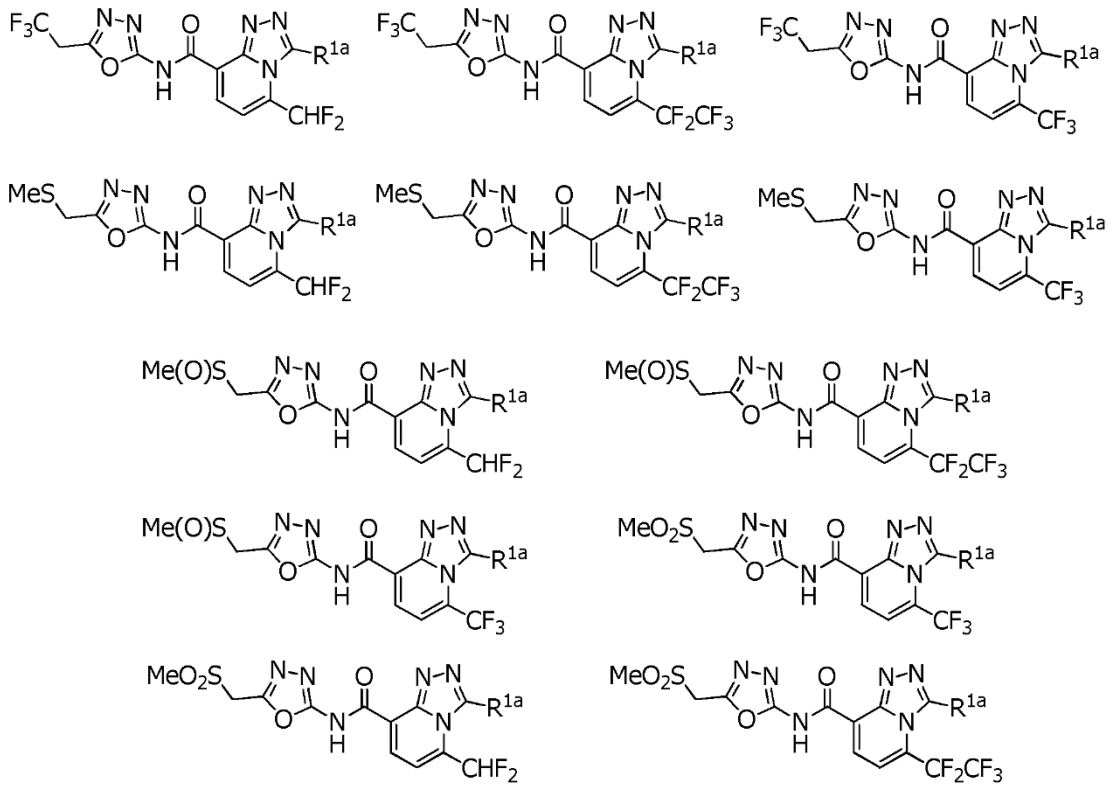


















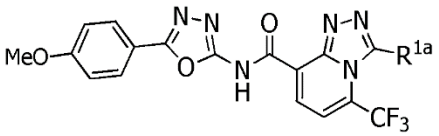
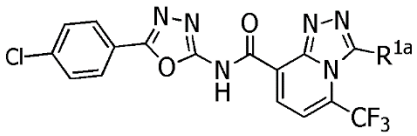
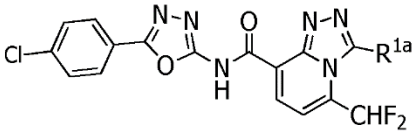
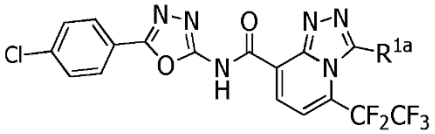
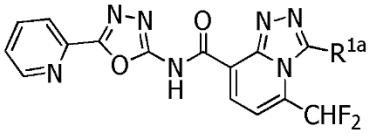
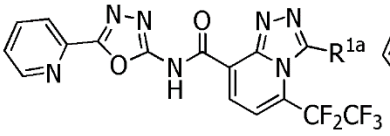
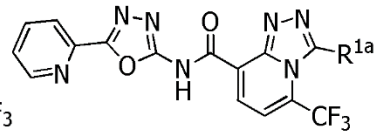
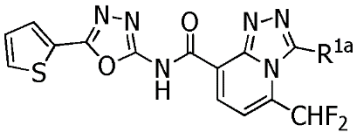
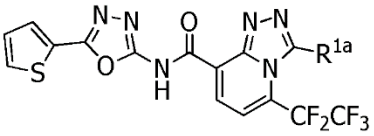
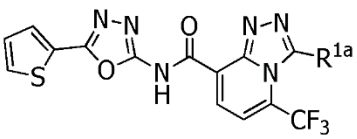
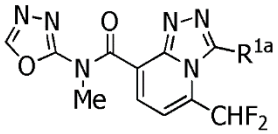
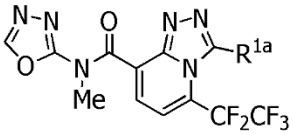
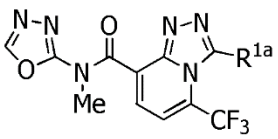
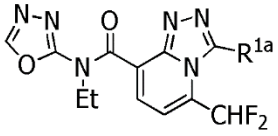
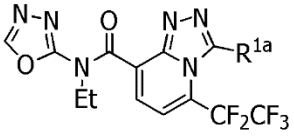
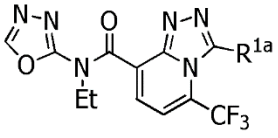
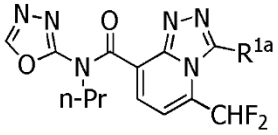
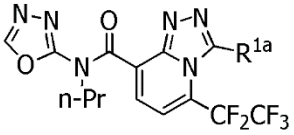
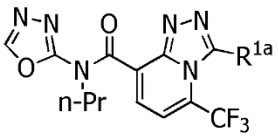
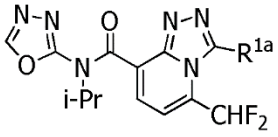
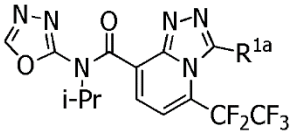
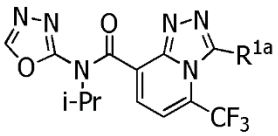




























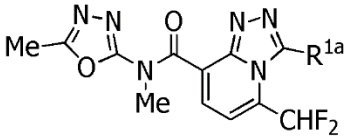
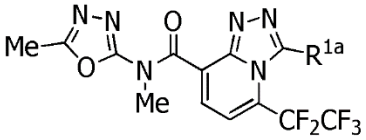
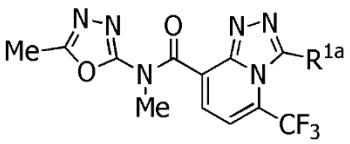
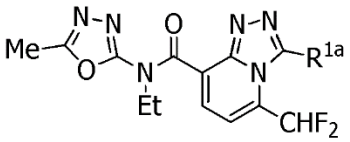
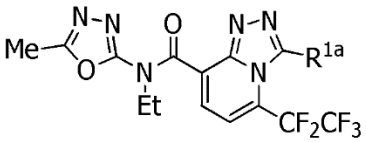
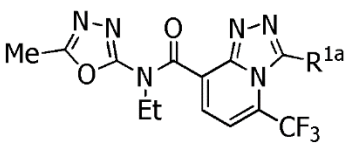
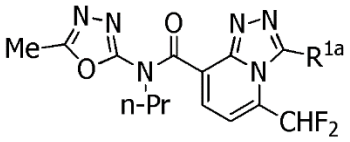
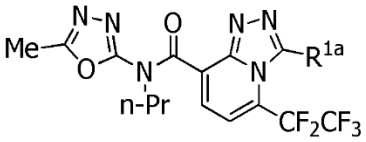
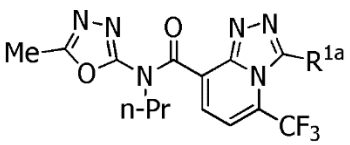
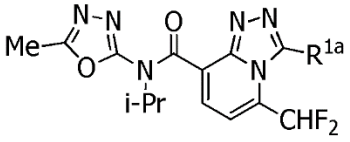
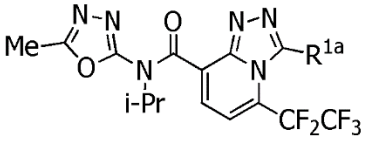
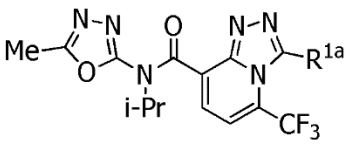
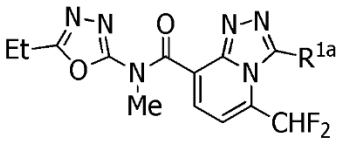
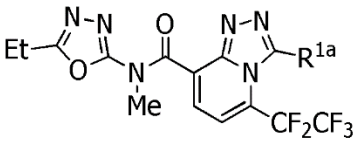
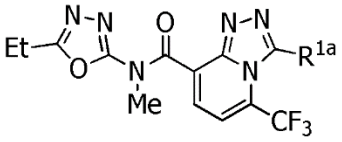
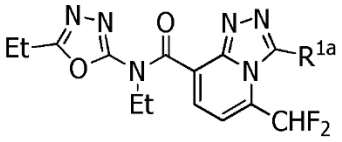
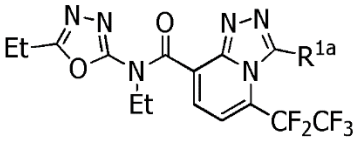
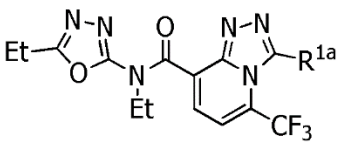
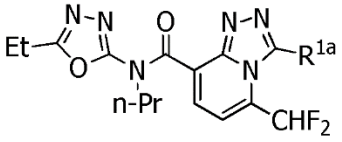
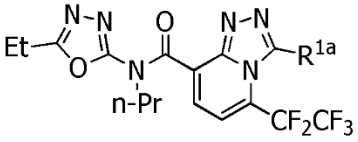
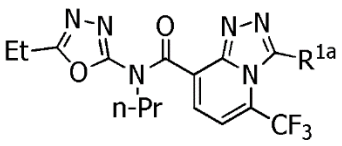
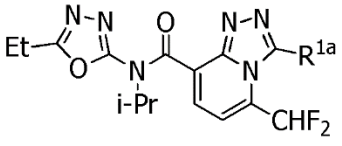
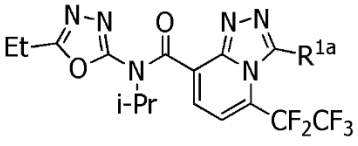
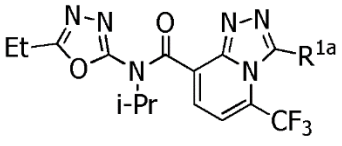


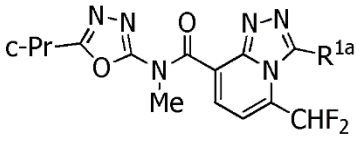
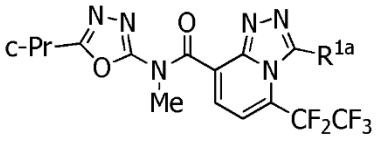
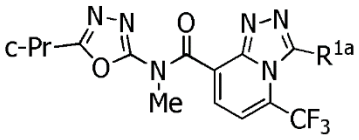
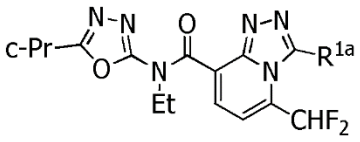
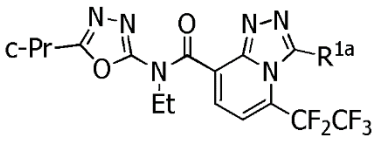
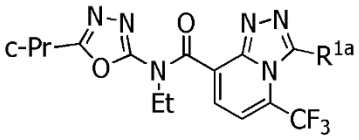
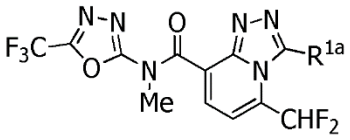
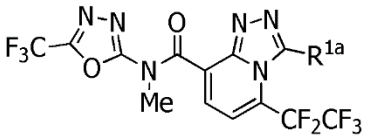
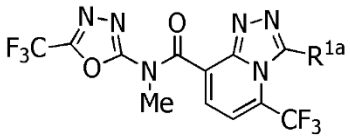
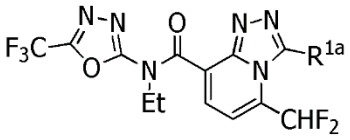
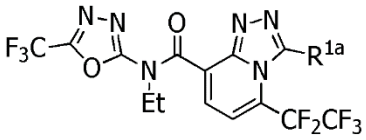
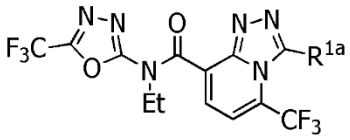
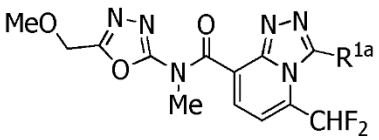
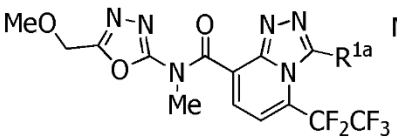
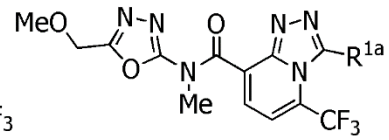
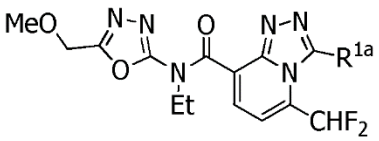
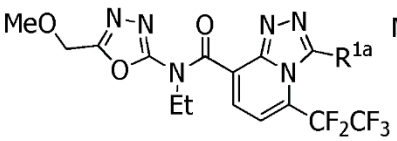
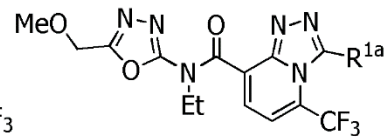


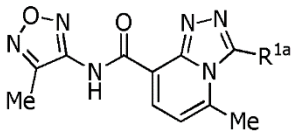
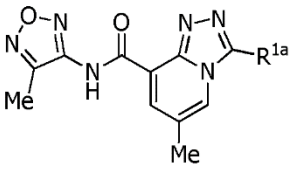
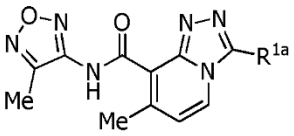
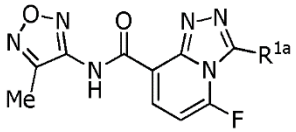
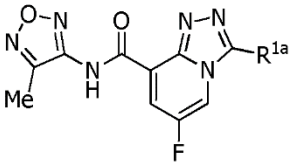




























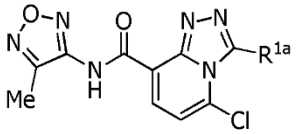
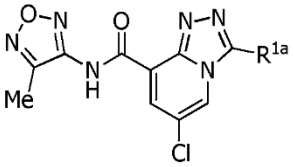
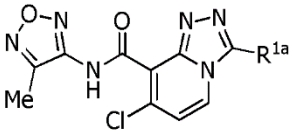
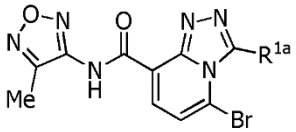
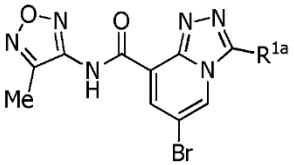
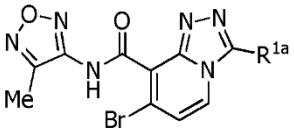
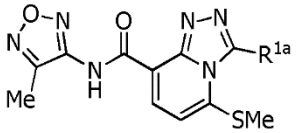
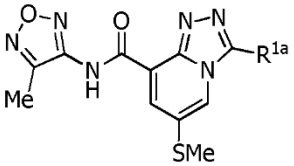
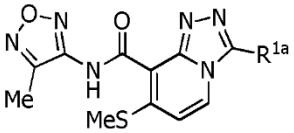
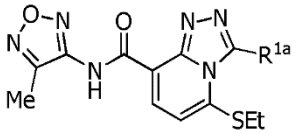
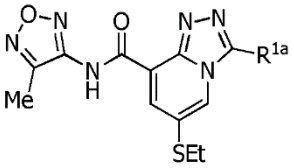
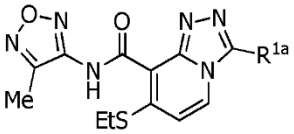
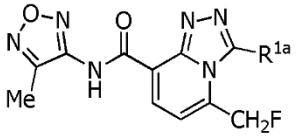
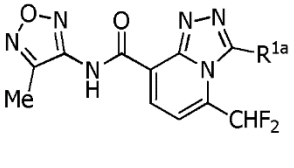
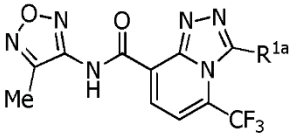
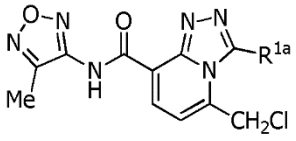
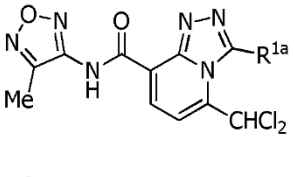
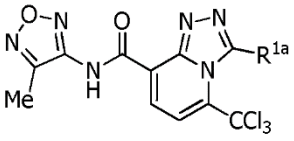
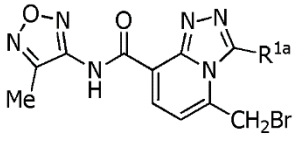
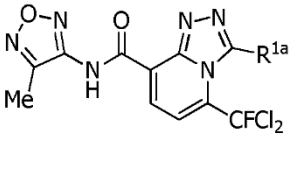
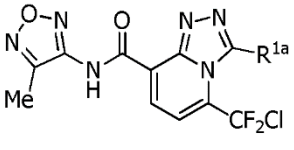


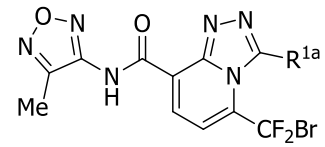
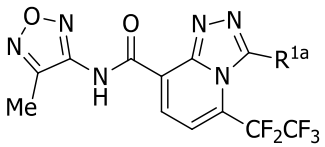
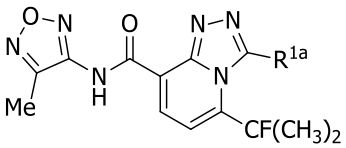
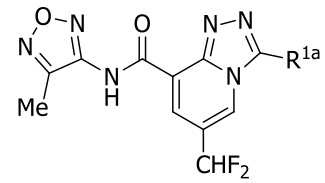
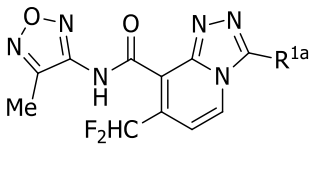
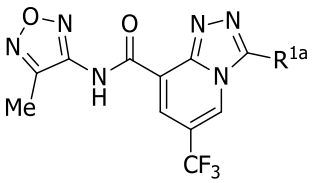
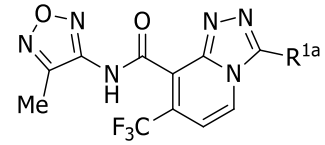
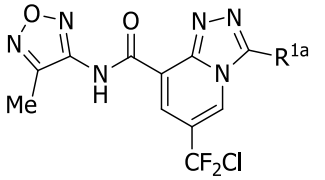
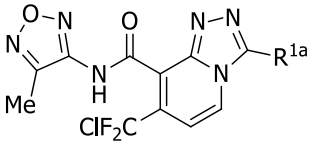
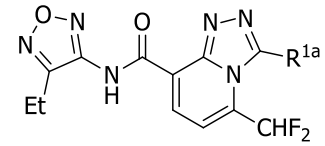
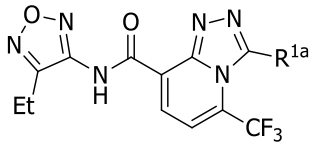
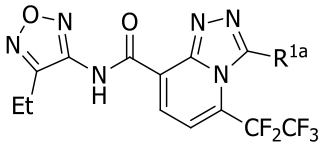
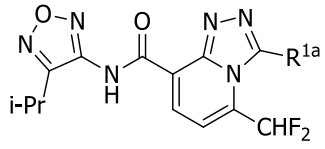
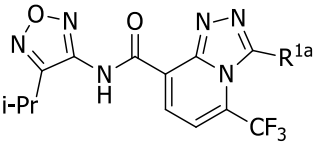
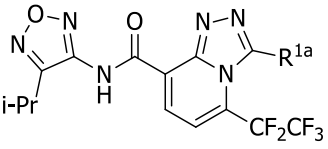
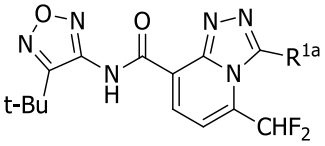
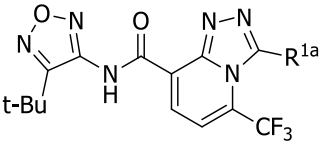
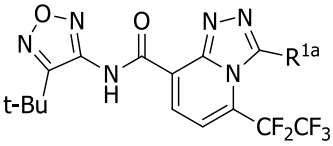
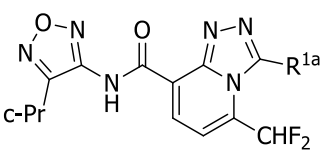
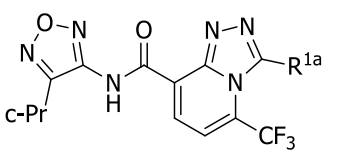
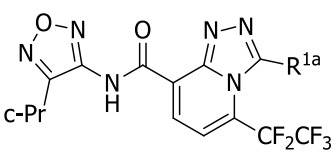
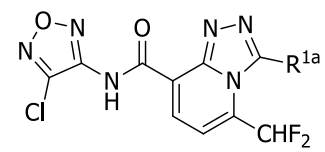
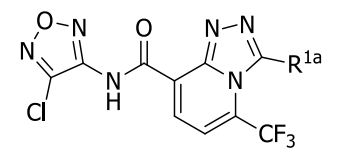
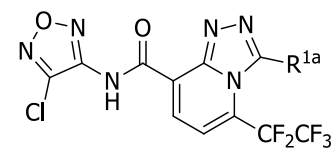
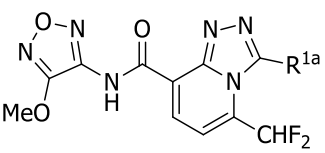
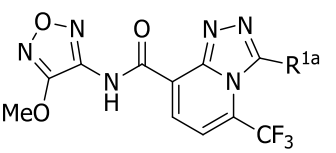
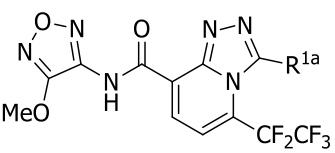























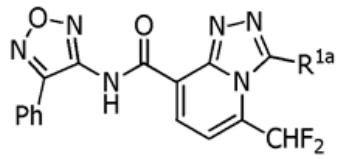
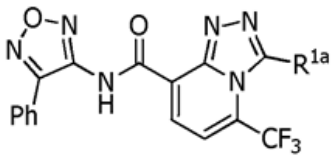
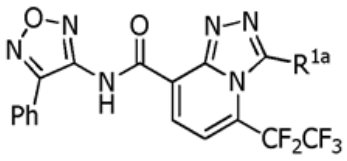
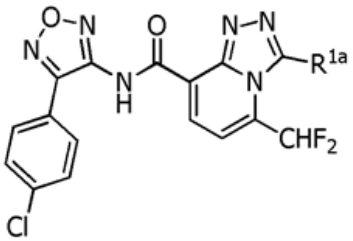
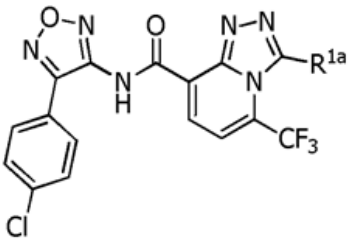
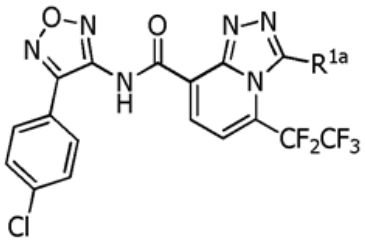
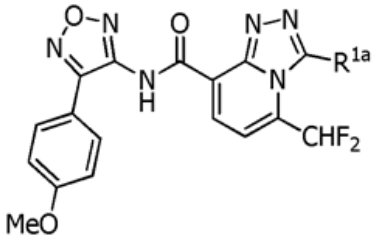
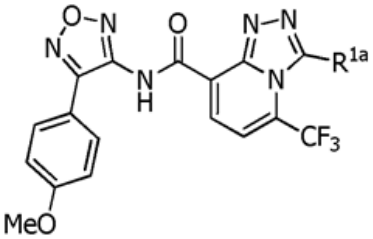
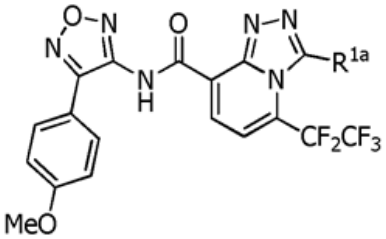

























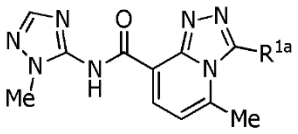
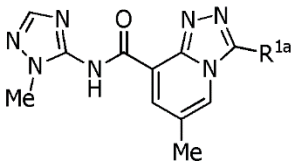
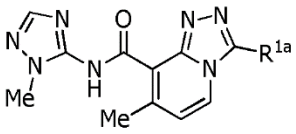
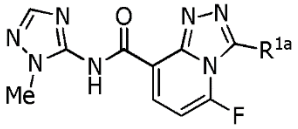
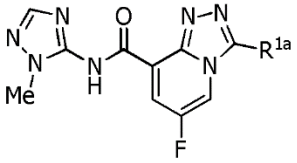



















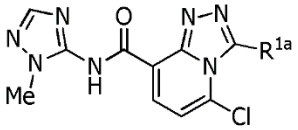
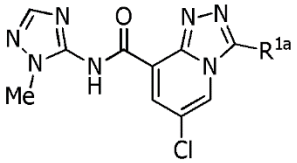
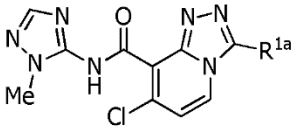
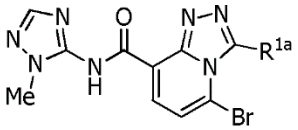
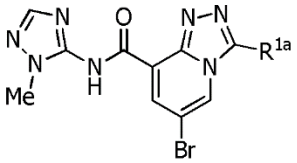






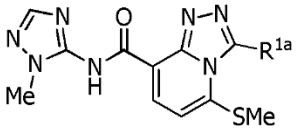
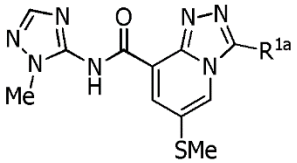
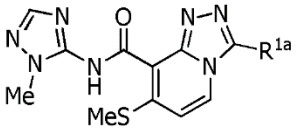
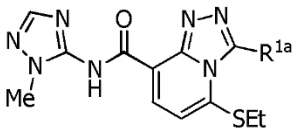
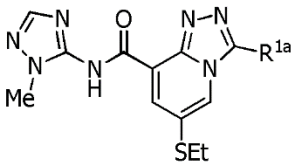
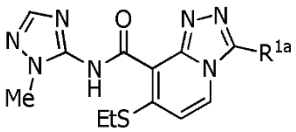
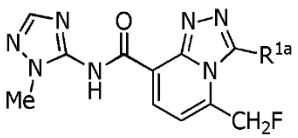
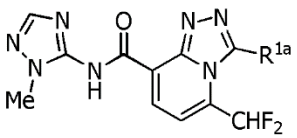
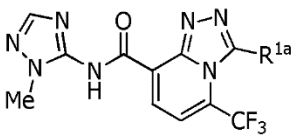
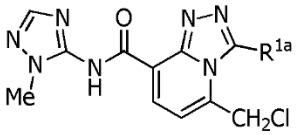
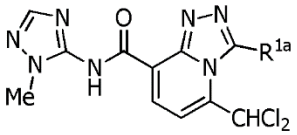
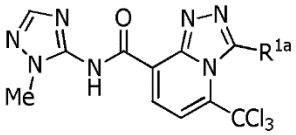
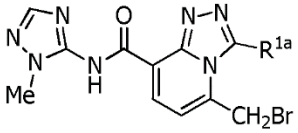
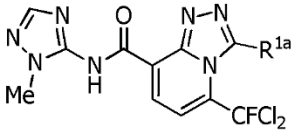
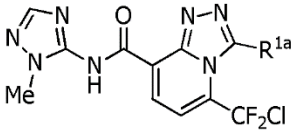






















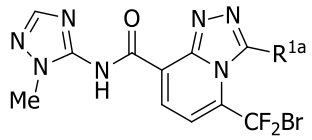




























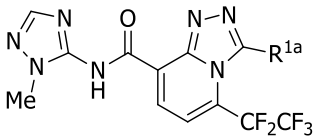










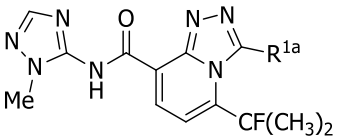






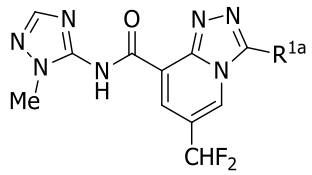






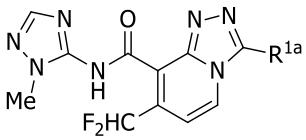
















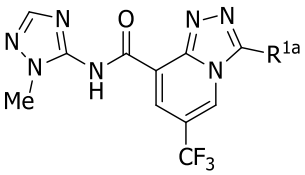


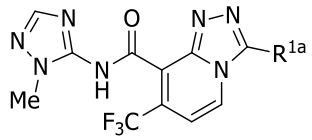


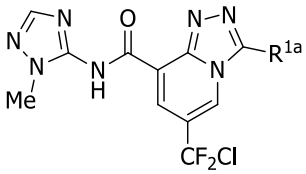


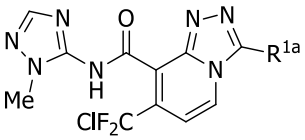


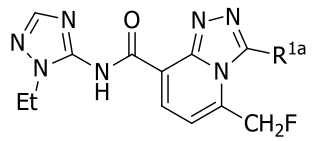


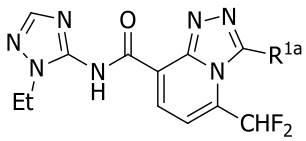


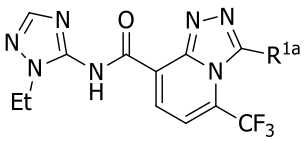


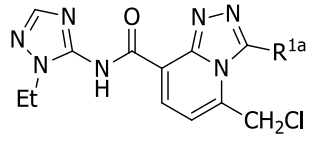


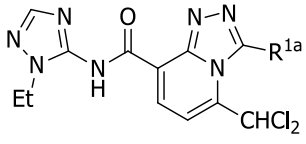


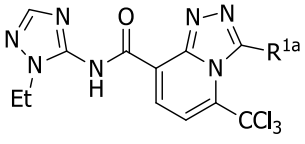


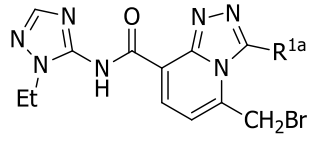


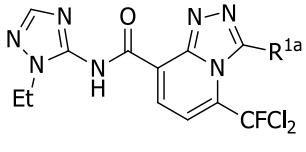


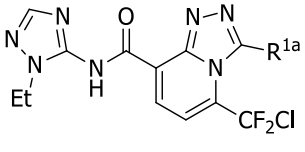


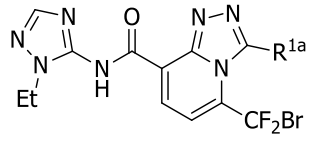


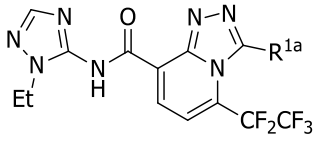


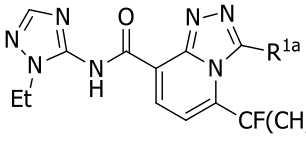


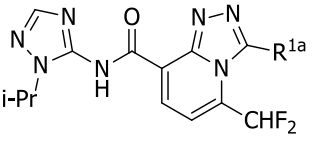


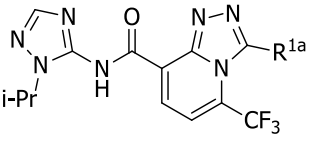


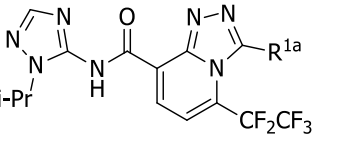


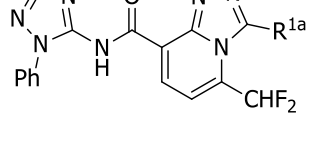


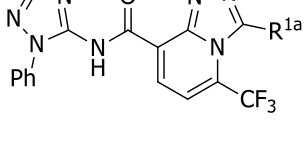


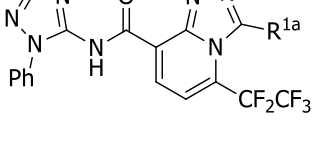


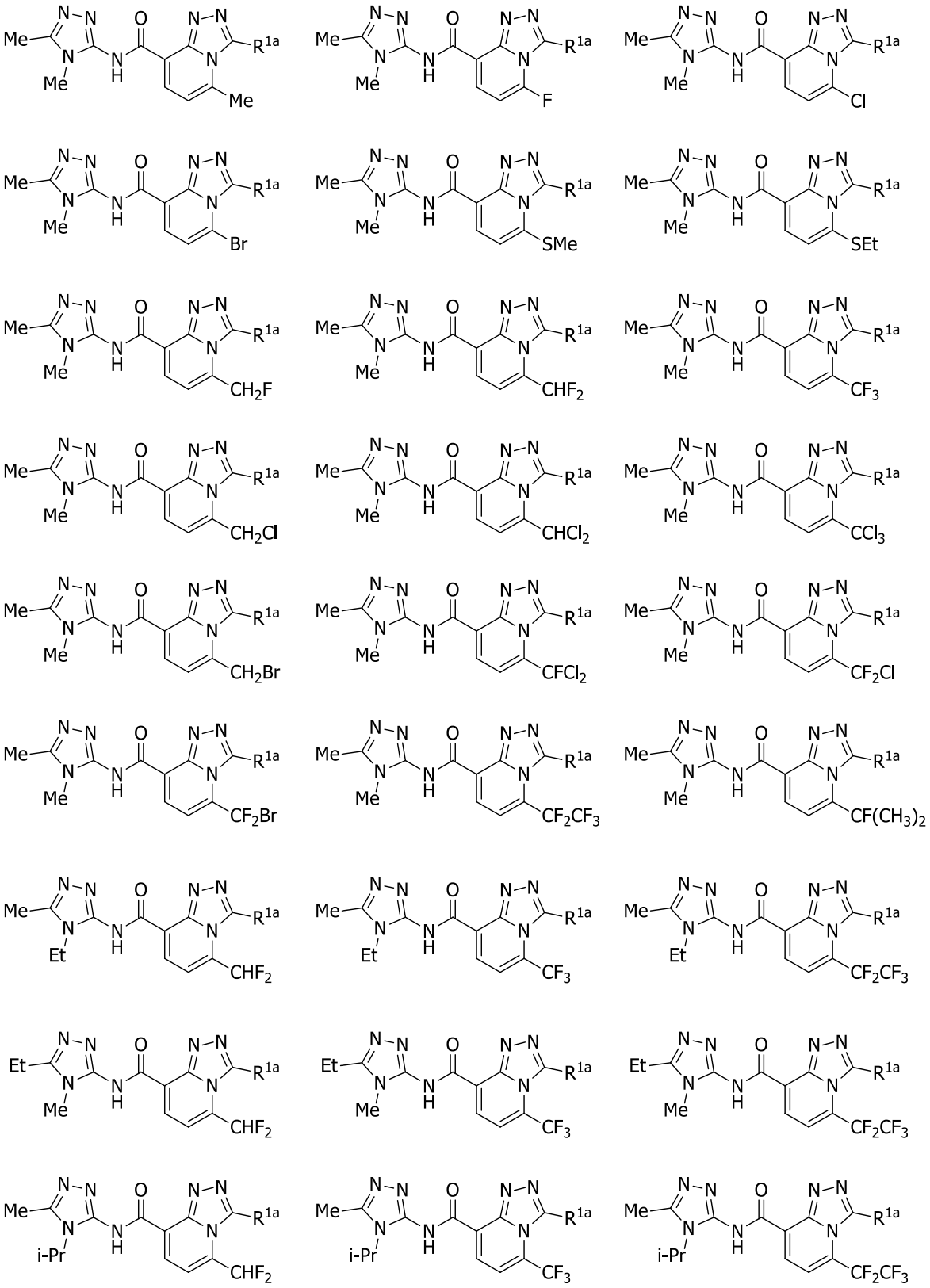












[Tabla 1]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
H	CH_2CF_3	$C(Me)_2CH_2CN$
F	$(CH_2)_3Cl$	CH_2Pr-c
Cl	$(CH_2)_3Br$	CH_2(D-16)
Br	$(CH_2)_2CF_3$	CH_2(D-16d)
I	$CHFCH_3$	CH_2Bu-c
Me	CF_2CH_3	CH_2Pen-c
Et	$CF(CH_3)_2$	CH_2Hex-c
Pr-n	CF_2CF_2H	CH(Me)Pr-c
Pr-i	CF_2CF_3	CH(Me)(D-16)
Pr-c	$CF_2CF_2CF_3$	CH(Me)(D-16e)
Bu-n	$CF(CF_3)$	CH(Me)Bu-c
Bu-i	CH(Me)Cl	CH(Me)Pen-c
Bu-c	CH(Me)Br	CH(Me)Hex-c
Bu-s	CH(Et)Cl	$(CH_2)_2Pr$-c
Bu-t	CH(Et)Br	$(CH_2)_2$(D-16)
Pen-n	CH(Pr-n)Cl	$(CH_2)_2$(D-16e)
Pen-i	CH(Pr-n)Br	$(CH_2)_2Bu$-c
Pen-c	CH(Pr-i)Cl	$(CH_2)_2Pen$-c
Pen-s	CH(Pr-i)Br	$(CH_2)_2Hex$-c
Pen-t	$C(Me)_2Cl$	CH_2OMe
3-Pen	$C(Me)_2Br$	CH_2OEt
Hex-n	$CH(Me)CH_2Cl$	CH_2OPr-n
Hex-c	$CH(Me)CH_2Br$	CH_2OPr-i
CH_2Cl	$C(Me)_2CH_2Cl$	CH_2OBu-n
CH_2Br	$C(Me)_2CH_2Br$	CH_2OBu-i
$CHBr_2$	CH_2CN	CH_2OBu-s
CF_2H	$(CH_2)_2CN$	CH_2OBu-t
CF_2Cl	$(CH_2)_3CN$	CH_2OPen-n
CF_2Br	CH(Me)CN	CH_2OPen-i
CF_3	CH(Et)CN	CH_2OPen-s
$(CH_2)_2Cl$	CH(Pr-n)CN	CH_2OPen-t
$(CH_2)_2Br$	CH(Pr-i)CN	CH_2OHex-n
CH_2CF_2H	$C(Me)_2CN$	CH(Me)OMe
CH_2CF_2Cl	$CH(Me)CH_2CN$	CH(Me)OEt
CH_2CF_2Br	$CH(Et)CH_2CN$	CH(Me)OPr-n

[Tabla 2]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
CH(Me)OPr–i	$C(Me)_2OBu$–n	$CH_2O(CH_2)_2Cl$
CH(Me)OBu–n	$C(Me)_2OBu$–i	$CH_2O(CH_2)_2Br$
CH(Me)OBu–i	$C(Me)_2OBu$–s	$CH(Me)OCF_2H$
CH(Me)OBu–s	$C(Me)_2OBu$–t	$CH(Me)OCF_3$
CH(Me)OBu–t	$(CH_2)_2OMe$	$CH(Me)OCH_2CF_2H$
CH(Me)OPen–n	$(CH_2)_2OEt$	$CH(Me)OCH_2CF_3$
CH(Me)OPen–i	$(CH_2)_2OPr$–n	$CH(Me)O(CH_2)_2CF_3$
CH(Me)OPen–s	$(CH_2)_2OPr$–i	$CH(Me)O(CH_2)_2Cl$
CH(Me)OPen–t	$(CH_2)_2OBu$–n	$CH(Me)O(CH_2)_2Br$
CH(Me)OHex–n	$(CH_2)_2OBu$–i	$CH(Et)OCF_2H$
CH(Et)OMe	$(CH_2)_2OBu$–s	$CH(Et)OCF_3$
CH(Et)OEt	$(CH_2)_2OBu$–t	$CH(Et)OCH_2CF_2H$
CH(Et)OPr–n	$CH(Me)CH_2OMe$	$CH(Et)OCH_2CF_3$
CH(Et)OPr–i	$CH(Me)CH_2OEt$	$CH(Et)O(CH_2)_2CF_3$
CH(Et)OBu–n	$CH(Me)CH_2OPr$–n	$CH(Et)O(CH_2)_2Cl$
CH(Et)OBu–i	$CH(Me)CH_2OPr$–i	$CH(Et)O(CH_2)_2Br$
CH(Et)OBu–s	$CH(Me)CH_2OBu$–n	$C(Me)_2OCF_2H$
CH(Et)OBu–t	$CH(Me)CH_2OBu$–i	$C(Me)_2OCF_3$
CH(Et)OPen–n	$CH(Me)CH_2OBu$–s	$C(Me)_2OCH_2CF_2H$
CH(Et)OPen–i	$CH(Me)CH_2OBu$–t	$C(Me)_2OCH_2CF_3$
CH(Et)OPen–s	$CH(Et)CH_2OMe$	$C(Me)_2O(CH_2)_2CF_3$
CH(Et)OPen–t	$CH(Et)CH_2OEt$	$C(Me)_2O(CH_2)_2Cl$
CH(Et)OHex–n	$(CH_2)_3OMe$	$C(Me)_2O(CH_2)_2Br$
CH(Pr–n)OMe	$(CH_2)_3OEt$	$(CH_2)_2OCF_3$
CH(Pr–n)OEt	$(CH_2)_3OPr$–n	$(CH_2)_2OCH_2CF_2H$
CH(Pr–n)OPr–n	$(CH_2)_3OPr$–i	$(CH_2)_2OCH_2CF_3$
CH(Pr–n)OPr–i	$(CH_2)_3OBu$–n	$(CH_2)_2O(CH_2)_2Cl$
CH(Pr–i)OMe	$(CH_2)_3OBu$–i	$(CH_2)_2O(CH_2)_2Br$
CH(Pr–i)OEt	$(CH_2)_3OBu$–s	CH_2OH
CH(Pr–i)OPr–n	$(CH_2)_3OBu$–t	CH(Me)OH
CH(Pr–i)OPr–i	CH_2OCF_2H	CH(Et)OH
$C(Me)_2OMe$	CH_2OCF_3	CH(iPr)OH
$C(Me)_2OEt$	$CH_2OCH_2CF_2H$	$C(Me)_2OH$
$C(Me)_2OPr$–n	$CH_2OCH_2CF_3$	$(CH_2)_2OH$
$C(Me)_2OPr$–i	$CH_2O(CH_2)_2CF_3$	$CH(Me)CH_2OH$

[Tabla 3]

R^{1a}
$(CH_2)_3OH$
CH_2OCH_2OMe
CH_2OCH_2OEt
$CH_2OCH_2OPr\text{-}n$
$CH_2OCH_2OPr\text{-}i$
$CH_2O(CH_2)_2OMe$
$CH_2O(CH_2)_2OEt$
$CH_2O(CH_2)_2OPr\text{-}n$
$CH_2O(CH_2)_2OPr\text{-}i$
$CH_2OCH(Me)CH_2OMe$
$CH_2OCH(Me)CH_2OEt$
$CH_2OCH_2CH(Me)OMe$
$CH_2OCH_2CH(Me)OEt$
$CH_2OCH(Me)OMe$
$CH_2OCH(Me)OEt$
$CH_2O(CH_2)_3OMe$
$CH_2O(CH_2)_3OEt$
$CH(Me)OCH_2OMe$
$CH(Me)OCH_2OEt$
$CH(Me)OCH_2OPr\text{-}n$
$CH(Me)OCH_2OPr\text{-}i$
$CH(Me)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Me)O(CH_2)_2OEt$
$CH(Me)O(CH_2)_2OPr\text{-}n$
$CH(Me)O(CH_2)_2OPr\text{-}i$
$CH(Me)OCH(Me)CH_2OMe$
$CH(Me)OCH(Me)CH_2OEt$
$CH(Me)OCH_2CH(Me)OMe$
$CH(Me)OCH_2CH(Me)OEt$
$C(Me)_2OCH_2OMe$
$C(Me)_2OCH_2OEt$
$C(Me)_2OCH_2OPr\text{-}n$
$C(Me)_2OCH_2OPr\text{-}i$
$C(Me)_2O(CH_2)_2OMe$
$C(Me)_2O(CH_2)_2OEt$

R^{1a}
$C(Me)_2O(CH_2)_2OPr\text{-}n$
$C(Me)_2O(CH_2)_2OPr\text{-}i$
$(CH_2)_2OCH_2OMe$
$(CH_2)_2OCH_2OEt$
$(CH_2)_2OCH_2OPr\text{-}n$
$(CH_2)_2OCH_2OPr\text{-}i$
$(CH_2)_2O(CH_2)_2OMe$
$(CH_2)_2O(CH_2)_2OEt$
$(CH_2)_2O(CH_2)_2OPr\text{-}n$
$(CH_2)_2O(CH_2)_2OPr\text{-}i$
$CH(Me)CH_2OCH_2OMe$
$CH(Me)CH_2OCH_2OEt$
$CH(Me)CH_2O(CH_2)_2OMe$
$CH(Me)CH_2O(CH_2)_2OEt$
$CH(Et)CH_2OCH_2OMe$
$CH(Et)CH_2OCH_2OEt$
$CH(Et)CH_2O(CH_2)_2OMe$
$CH(Et)CH_2O(CH_2)_2OEt$
$CH(Et)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Et)O(CH_2)_2OEt$
$CH(Et)O(CH_2)_2OPr\text{-}n$
$CH(Et)O(CH_2)_2OPr\text{-}i$
$CH(Pr\text{-}n)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Pr\text{-}n)O(CH_2)_2OEt$
$CH(Pr\text{-}n)O(CH_2)_2OPr\text{-}n$
$CH(Pr\text{-}n)O(CH_2)_2OPr\text{-}i$
$CH(Pr\text{-}i)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Pr\text{-}i)O(CH_2)_2OEt$
$CH(Pr\text{-}i)O(CH_2)_2OPr\text{-}n$
$CH(Pr\text{-}i)O(CH_2)_2OPr\text{-}i$
$CH_2OC(O)Me$
$CH_2OC(O)Et$
$CH_2OC(O)Pr\text{-}i$
$CH(Me)OC(O)Me$
$CH(Me)OC(O)Et$

R^{1a}
$CH(Me)OC(O)Pr\text{-}i$
$CH(Et)OC(O)Me$
$CH(Et)OC(O)Et$
$CH(Et)OC(O)Pr\text{-}i$
CH_2OPh
$CH(Me)OPh$
$CH_2C(O)OH$
$CH_2C(O)OMe$
$CH_2C(O)OEt$
$CH_2C(O)OPr\text{-}n$
$CH_2C(O)OPr\text{-}i$
$CH_2C(O)OBu\text{-}n$
$CH_2C(O)OBu\text{-}i$
$CH_2C(O)OBu\text{-}s$
$CH_2C(O)OBu\text{-}t$
$CH_2C(O)OPen\text{-}n$
$CH_2C(O)OPen\text{-}i$
$CH_2C(O)OPen\text{-}s$
$CH_2C(O)OPen\text{-}t$
$CH_2C(O)OHex\text{-}n$
$CH_2C(O)OCH_2OMe$
$CH_2C(O)O(CH_2)_2OMe$
$CH_2C(O)O(CH_2)_2OEt$
$CH_2C(O)O(CH_2)_2OPr\text{-}i$
$CH_2C(O)NHMe$
$CH_2C(O)NHEt$
$CH_2C(O)NHPr\text{-}n$
$CH_2C(O)NHPr\text{-}i$
$CH(Me)C(O)OH$
$CH(Me)C(O)OMe$
$CH(Me)C(O)OEt$
$CH(Me)C(O)OPr\text{-}i$
$CH(Me)C(O)OCH_2OMe$
$CH(Me)C(O)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Me)C(O)O(CH_2)_2OEt$

[Taba 4]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
CH(Me)C(O)O$(CH_2)_2$OPr-i	$CH_2S(O)_2$Pr-i	CH(Me)SPr-i
CH(Me)C(O)NHMe	CH_2SBu-n	CH(Me)S(O)Pr-i
CH(Me)C(O)NHEt	$CH_2S(O)$Bu-n	CH(Me)$S(O)_2$Pr-i
CH(Me)C(O)NHPr-n	$CH_2S(O)_2$Bu-n	CH(Me)SBu-n
CH(Me)C(O)NHPr-i	CH_2SBu-i	CH(Me)S(O)Bu-n
CH(Et)C(O)OH	$CH_2S(O)$Bu-i	CH(Me)$S(O)_2$Bu-n
CH(Et)C(O)OMe	$CH_2S(O)_2$Bu-i	CH(Me)SBu-i
CH(Et)C(O)OEt	CH_2SBu-s	CH(Me)S(O)Bu-i
CH(Et)C(O)OPr-i	$CH_2S(O)$Bu-s	CH(Me)$S(O)_2$Bu-i
CH(Et)C(O)OCH_2OMe	$CH_2S(O)_2$Bu-s	CH(Me)SBu-s
CH(Et)C(O)O$(CH_2)_2$OMe	CH_2SBu-t	CH(Me)S(O)Bu-s
CH(Et)C(O)O$(CH_2)_2$OEt	$CH_2S(O)$Bu-t	CH(Me)$S(O)_2$Bu-s
CH(Et)C(O)O$(CH_2)_2$OPr-i	$CH_2S(O)_2$Bu-t	CH(Me)SBu-t
CH(Et)C(O)NHMe	CH_2SPen-n	CH(Me)S(O)Bu-t
CH(Et)C(O)NHEt	$CH_2S(O)$Pen-n	CH(Me)$S(O)_2$Bu-t
$(CH_2)_2$C(O)OH	$CH_2S(O)_2$Pen-n	CH(Me)SPen-n
$(CH_2)_2$C(O)OMe	CH_2SPen-i	CH(Me)S(O)Pen-n
$(CH_2)_2$C(O)OEt	$CH_2S(O)$Pen-i	CH(Me)$S(O)_2$Pen-n
$(CH_2)_2$C(O)O$(CH_2)_2$OMe	$CH_2S(O)_2$Pen-i	CH(Me)SPen-i
$(CH_2)_2$C(O)O$(CH_2)_2$OEt	CH_2SPen-s	CH(Me)S(O)Pen-i
$(CH_2)_2$C(O)NHMe	$CH_2S(O)$Pen-s	CH(Me)$S(O)_2$Pen-i
$(CH_2)_2$C(O)NHEt	$CH_2S(O)_2$Pen-s	CH(Me)SPen-s
$(CH_2)_2$C(O)NHPr-n	CH_2SPen-t	CH(Me)S(O)Pen-s
$(CH_2)_2$C(O)NHPr-i	$CH_2S(O)$Pen-t	CH(Me)$S(O)_2$Pen-s
CH_2SMe	$CH_2S(O)_2$Pen-t	CH(Me)SPen-t
$CH_2S(O)$Me	CH_2SHex-n	CH(Me)S(O)Pen-t
$CH_2S(O)_2$Me	CH(Me)SMe	CH(Me)$S(O)_2$Pen-t
CH_2SEt	CH(Me)S(O)Me	CH(Me)SHex-n
$CH_2S(O)$Et	CH(Me)$S(O)_2$Me	$C(Me)_2$SMe
$CH_2S(O)_2$Et	CH(Me)SEt	$C(Me)_2S(O)$Me
CH_2SPr-n	CH(Me)S(O)Et	$C(Me)_2S(O)_2$Me
$CH_2S(O)$Pr-n	CH(Me)$S(O)_2$Et	$C(Me)_2$SEt
$CH_2S(O)_2$Pr-n	CH(Me)SPr-n	$C(Me)_2S(O)$Et
CH_2SPr-i	CH(Me)S(O)Pr-n	$C(Me)_2S(O)_2$Et
$CH_2S(O)$Pr-i	CH(Me)$S(O)_2$Pr-n	$C(Me)_2$SPr-n

[Tabla 5]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$C(Me)_2S(O)Pr-n$	$(CH_2)_2SPr-n$	$C(Me)_2CH_2S(O)_2Et$
$C(Me)_2S(O)_2Pr-n$	$(CH_2)_2S(O)Pr-n$	$C(Me)_2CH_2SPr-n$
$C(Me)_2SPr-i$	$(CH_2)_2S(O)_2Pr-n$	$C(Me)_2CH_2S(O)Pr-n$
$C(Me)_2S(O)Pr-i$	$(CH_2)_2SPr-i$	$C(Me)_2CH_2S(O)_2Pr-n$
$C(Me)_2S(O)_2Pr-i$	$(CH_2)_2S(O)Pr-i$	$C(Me)_2CH_2SPr-i$
$C(Me)_2SBu-n$	$(CH_2)_2S(O)_2Pr-i$	$C(Me)_2CH_2S(O)Pr-i$
$C(Me)_2S(O)Bu-n$	$(CH_2)_3SMe$	$C(Me)_2CH_2S(O)_2Pr-i$
$C(Me)_2S(O)_2Bu-n$	$(CH_2)_3(O)Me$	$CH(Et)SMe$
$C(Me)_2SBu-i$	$(CH_2)_3S(O)_2Me$	$CH(Et)S(O)Me$
$C(Me)_2S(O)Bu-i$	$(CH_2)_3SEt$	$CH(Et)S(O)_2Me$
$C(Me)_2S(O)_2Bu-i$	$(CH_2)_3S(O)Et$	$CH(Et)SEt$
$C(Me)_2SBu-s$	$(CH_2)_3S(O)_2Et$	$CH(Et)S(O)Et$
$C(Me)_2S(O)Bu-s$	$CH(Me)CH_2SMe$	$CH(Et)S(O)_2Et$
$C(Me)_2S(O)_2Bu-s$	$CH(Me)CH_2S(O)Me$	$CH(Et)SPr-n$
$C(Me)_2SBu-t$	$CH(Me)CH_2S(O)_2Me$	$CH(Et)S(O)Pr-n$
$C(Me)_2S(O)Bu-t$	$CH(Me)CH_2SEt$	$CH(Et)S(O)_2Pr-n$
$C(Me)_2S(O)_2Bu-t$	$CH(Me)CH_2S(O)Et$	$CH(Et)SPr-i$
$C(Me)_2SPen-n$	$CH(Me)CH_2S(O)_2Et$	$CH(Et)S(O)Pr-i$
$C(Me)_2S(O)Pen-n$	$CH(Me)CH_2SPr-n$	$CH(Et)S(O)_2Pr-i$
$C(Me)_2S(O)_2Pen-n$	$CH(Me)CH_2S(O)Pr-n$	$CH(Pr-n)SMe$
$C(Me)_2SPen-i$	$CH(Me)CH_2S(O)_2Pr-n$	$CH(Pr-n)S(O)Me$
$C(Me)_2S(O)Pen-i$	$CH(Me)CH_2SPr-i$	$CH(Pr-n)S(O)_2Me$
$C(Me)_2S(O)_2Pen-i$	$CH(Me)CH_2S(O)Pr-i$	$CH(Pr-n)SEt$
$C(Me)_2SPen-s$	$CH(Me)CH_2S(O)_2Pr-i$	$CH(Pr-n)S(O)Et$
$C(Me)_2S(O)Pen-s$	$CH(Et)CH_2SMe$	$CH(Pr-n)S(O)_2Et$
$C(Me)_2S(O)_2Pen-s$	$CH(Et)CH_2S(O)Me$	$CH(Pr-n)SPr-n$
$C(Me)_2SPen-t$	$CH(Et)CH_2S(O)_2Me$	$CH(Pr-n)S(O)Pr-n$
$C(Me)_2S(O)Pen-t$	$CH(Et)CH_2SEt$	$CH(Pr-n)S(O)_2Pr-n$
$C(Me)_2S(O)_2Pen-t$	$CH(Et)CH_2S(O)Et$	$CH(Pr-n)SPr-i$
$(CH_2)_2SMe$	$CH(Et)CH_2S(O)_2Et$	$CH(Pr-n)S(O)Pr-i$
$(CH_2)_2S(O)Me$	$C(Me)_2CH_2SMe$	$CH(Pr-n)S(O)_2Pr-i$
$(CH_2)_2S(O)_2Me$	$C(Me)_2CH_2S(O)Me$	$CH(Pr-i)SMe$
$(CH_2)_2SEt$	$C(Me)_2CH_2S(O)_2Me$	$CH(Pr-i)S(O)Me$
$(CH_2)_2S(O)Et$	$C(Me)_2CH_2SEt$	$CH(Pr-i)S(O)_2Me$
$(CH_2)_2S(O)_2Et$	$C(Me)_2CH_2S(O)Et$	$CH(Pr-i)SEt$

[Tabla 6]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
CH(Pr-i)S(O)Et	$CH_2SCF(CF_3)_2$	$C(Me)_2S(O)(CH_2)_2CF_3$
CH(Pr-i)$S(O)_2$Et	$CH(Me)SCF_2H$	$C(Me)_2S(O)_2(CH_2)_2CF_3$
CH(Pr-i)SPr-n	$CH(Me)S(O)CF_2H$	$C(Me)_2S(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-i)S(O)Pr-n	$CH(Me)S(O)_2CF_2H$	$C(Me)_2S(O)(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-i)$S(O)_2$Pr-n	$CH(Me)SCF_3$	$C(Me)_2S(O)_2(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-i)SPr-i	$CH(Me)S(O)CF_3$	$C(Me)_2S(CH_2)_2Br$
CH(Pr-i)S(O)Pr-i	$CH(Me)S(O)_2CF_3$	$C(Me)_2S(O)(CH_2)_2Br$
CH(Pr-i)$S(O)_2$Pr-i	$CH(Me)SCH_2CF_2H$	$C(Me)_2S(O)_2(CH_2)_2Br$
CH_2SCF_2H	$CH(Me)S(O)CH_2CF_2H$	$(CH_2)_2SCF_3$
$CH_2S(O)CF_2H$	$CH(Me)S(O)_2CH_2CF_2H$	$(CH_2)_2S(O)CF_3$
$CH_2S(O)_2CF_2H$	$CH(Me)SCH_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)_2CF_3$
CH_2SCF_3	$CH(Me)S(O)CH_2CF_3$	$(CH_2)_2SCH_2CF_2H$
$CH_2S(O)CF_3$	$CH(Me)S(O)_2CH_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)CH_2CF_2H$
$CH_2S(O)_2CF_3$	$CH(Me)S(CH_2)_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)_2CH_2CF_2H$
$CH_2SCH_2CF_2H$	$CH(Me)S(O)(CH_2)_2CF_3$	$(CH_2)_2SCH_2CF_3$
$CH_2S(O)CH_2CF_2H$	$CH(Me)S(O)_2(CH_2)_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)CH_2CF_3$
$CH_2S(O)_2CH_2CF_2H$	$CH(Me)S(CH_2)_2Cl$	$(CH_2)_2S(O)_2CH_2CF_3$
$CH_2SCH_2CF_3$	$CH(Me)S(O)(CH_2)_2Cl$	$(CH_2)_2S(CH_2)_2Cl$
$CH_2S(O)CH_2CF_3$	$CH(Me)S(O)_2(CH_2)_2Cl$	$(CH_2)_2S(O)(CH_2)_2Cl$
$CH_2S(O)_2CH_2CF_3$	$CH(Me)S(CH_2)_2Br$	$(CH_2)_2S(O)_2(CH_2)_2Cl$
$CH_2S(CH_2)_2CF_3$	$CH(Me)S(O)(CH_2)_2Br$	$(CH_2)_2S(CH_2)_2Br$
$CH_2S(O)(CH_2)_2CF_3$	$CH(Me)S(O)_2(CH_2)_2Br$	$(CH_2)_2S(O)(CH_2)_2Br$
$CH_2S(O)_2(CH_2)_2CF_3$	$C(Me)_2SCF_2H$	$(CH_2)_2S(O)_2(CH_2)_2Br$
$CH_2S(CH_2)_2Cl$	$C(Me)_2S(O)CF_2H$	$CH=CH_2$
$CH_2S(O)(CH_2)_2Cl$	$C(Me)_2S(O)_2CF_2H$	CH=CHMe
$CH_2S(O)_2(CH_2)_2Cl$	$C(Me)_2SCF_3$	$CH=CMe_2$
$CH_2S(CH_2)_2Br$	$C(Me)_2S(O)CF_3$	$CH_2CH=CH_2$
$CH_2S(O)(CH_2)_2Br$	$C(Me)_2S(O)_2CF_3$	$CH_2CH=CHMe$
$CH_2S(O)_2(CH_2)_2Br$	$C(Me)_2SCH_2CF_2H$	$CH_2C(Me)=CH_2$
$CH_2SCHFCH_3$	$C(Me)_2S(O)CH_2CF_2H$	$(CH_2)_2CH=CMe_2$
$CH_2SCF_2CH_3$	$C(Me)_2S(O)_2CH_2CF_2H$	$C(Me)=CH_2$
$CH_2SCF(CH_3)_2$	$C(Me)_2SCH_2CF_3$	C(Me)=CHMe
$CH_2SCF_2CF_2H$	$C(Me)_2S(O)CH_2CF_3$	$C(Me)=CMe_2$
$CH_2SCF_2CF_3$	$C(Me)_2S(O)_2CH_2CF_3$	$CH(Me)CH=CH_2$
$CH_2SCF_2CF_2CF_3$	$C(Me)_2S(CH_2)_2CF_3$	$C(Et)=CH_2$

[Tabla 7]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
C(Et)=CHMe	2,4-$(Cl)_2$-Ph	3-F-4-Cl-Ph
C(Et)=CMe_2	2,5-$(Cl)_2$-Ph	3-F-5-Cl-Ph
CH(Et)CH=CH_2	2,6-$(Cl)_2$-Ph	2-Me-3-F-Ph
C≡CH	3,4-$(Cl)_2$-Ph	2-Me-4-F-Ph
C≡CMe	3,5-$(Cl)_2$-Ph	2-Me-5-F-Ph
CH_2C≡CH	2,3-$(Me)_2$-Ph	3-Me-4-F-Ph
CH_2C≡CMe	2,4-$(Me)_2$-Ph	3-Me-5-F-Ph
CH(Me)C≡CH	2,5-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-3-MeO-Ph
CH(Me)C≡CMe	2,6-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-4-MeO-Ph
Ph	3,4-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-5-MeO-Ph
2-F-Ph	3,5-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-6-MeO-Ph
3-F-Ph	2,3-$(MeO)_2$-Ph	3-Cl-4-MeO-Ph
4-F-Ph	2,4-$(MeO)_2$-Ph	3-Cl-5-MeO-Ph
2-Cl-Ph	2,5-$(MeO)_2$-Ph	2-F-3-MeO-Ph
3-Cl-Ph	2,6-$(MeO)_2$-Ph	2-F-4-MeO-Ph
4-Cl-Ph	3,4-$(MeO)_2$-Ph	2-F-5-MeO-Ph
2-Br-Ph	3,5-$(MeO)_2$-Ph	2-F-6-MeO-Ph
3-Br-Ph	2-Cl-3-Me-Ph	3-F-4-MeO-Ph
4-Br-Ph	2-Cl-4-Me-Ph	3-F-5-MeO-Ph
2-Me-Ph	2-Cl-5-Me-Ph	2-MeO-3-F-Ph
3-Me-Ph	3-Cl-4-Me-Ph	2-MeO-4-F-Ph
4-Me-Ph	3-Cl-5-Me-Ph	2-MeO-5-F-Ph
2-CF_3-Ph	2-Cl-3-F-Ph	2-MeO-6-F-Ph
3-CF_3-Ph	2-Cl-4-F-Ph	3-MeO-4-F-Ph
4-CF_3-Ph	2-Cl-5-F-Ph	3-MeO-5-F-Ph
2-MeO-Ph	3-Cl-4-F-Ph	2-MeO-3-Cl-Ph
3-MeO-Ph	3-Cl-5-F-Ph	2-MeO-4-Cl-Ph
4-MeO-Ph	2-F-3-Me-Ph	2-MeO-5-Cl-Ph
2,3-$(F)_2$-Ph	2-F-4-Me-Ph	2-MeO-6-Cl-Ph
2,4-$(F)_2$-Ph	2-F-5-Me-Ph	3-MeO-4-Cl-Ph
2,5-$(F)_2$-Ph	3-F-4-Me-Ph	3-MeO-5-Cl-Ph
2,6-$(F)_2$-Ph	3-F-5-Me-Ph	2-Me-3-MeO-Ph
3,4-$(F)_2$-Ph	2-F-3-Cl-Ph	2-Me-4-MeO-Ph
3,5-$(F)_2$-Ph	2-F-4-Cl-Ph	2-Me-5-MeO-Ph
2,3-$(Cl)_2$-Ph	2-F-5-Cl-Ph	2-Me-6-MeO-Ph

[Tabla 8]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
3-Me-4-MeO-Ph	D-11	CH_2(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
3-Me-5-MeO-Ph	D-12	CH_2(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-3-Me-Ph	D-13a	CH_2(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-4-Me-Ph	D-14	CH_2(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-5-Me-Ph	D-16	CH(Me)(2-MeO-Ph)
2-MeO-6-Me-Ph	D-16a	CH(Me)(3-MeO-Ph)
3-MeO-4-Me-Ph	D-16b	CH(Me)(4-MeO-Ph)
3-MeO-5-Me-Ph	D-16c	CH(Me)(2,3-$(MeO)_2$-Ph)
3,5-$(F)_2$-4-Me-Ph	D-16d	CH(Me)(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
3,5-$(F)_2$-4-MeO-Ph	D-16e	CH(Me)(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
3,4,5-$(MeO)_3$-Ph	D-16f	CH(Me)(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
D-3	D-16g	CH(Me)(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
D-3a	D-16h	CH(Me)(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
D-4	D-16i	CH(Et)(2-MeO-Ph)
D-4a	D-16j	CH(Et)(3-MeO-Ph)
D-4b	D-16k	CH(Et)(4-MeO-Ph)
D-8	D-16m	$(CH_2)_2$(2-MeO-Ph)
D-8a	D-16n	$(CH_2)_2$(3-MeO-Ph)
D-8b	D-16p	$(CH_2)_2$(4-MeO-Ph)
D-8c	D-17	CHO
D-8d	D-17a	CH=NOMe
D-8e	D-17b	OMe
D-8f	D-19	OEt
D-8g	D-24a	OPr-n
D-8h	D-24b	OPr-i
D-9	D-24c	OBu-n
D-9a	D-24d	OBu-i
D-9c	D-24e	OBu-s
D-9d	D-24f	OBu-t
D-9f	CH_2Ph	OPen-n
D-9g	CH_2(2-MeO-Ph)	OPen-i
D-9i	CH_2(3-MeO-Ph)	OPen-s
D-9j	CH_2(4-MeO-Ph)	OPen-t
D-9m	CH_2(2,3-$(MeO)_2$-Ph)	OHex-n
D-10a	CH_2(2,4-$(MeO)_2$-Ph)	SMe

[Tabla 9]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
S(O)Me	SPen-n	$S(CH_2)_2Cl$
$S(O)_2Me$	S(O)Pen-n	$S(O)(CH_2)_2Cl$
SEt	$S(O)_2Pen-n$	$S(O)_2(CH_2)_2Cl$
S(O)Et	SPen-i	$SCH(Me)CH_2Cl$
$S(O)_2Et$	S(O)Pen-i	$SCH_2CH(Me)Cl$
SPr-n	$S(O)_2Pen-i$	$S(CH_2)_3Cl$
S(O)Pr-n	SPen-c	SCF_3
$S(O)_2Pr-n$	S(O)Pen-c	SCH_2CF_3
SPr-i	$S(O)_2Pen-c$	$S(O)CH_2CF_3$
S(O)Pr-i	SPen-s	$S(O)_2CH_2CF_3$
$S(O)_2Pr-i$	S(O)Pen-s	$SCH(Me)CF_3$
SPr-c	$S(O)_2Pen-s$	$S(CH_2)_2CF_3$
S(O)Pr-c	SPen-t	$S(CH_2)_3CF_3$
$S(O)_2Pr-c$	S(O)Pen-t	$SCHFCH_3$
S(D-16)	$S(O)_2Pen-t$	SCF_2CH_3
S(O)(D-16)	SHex-n	$SCF(CH_3)_2$
$S(O)_2$(D-16)	SHex-c	SCF_2CF_2H
S(D-16e)	$SCH_2CH=CH_2$	SCF_2CF_3
S(O)(D-16e)	$S(O)CH_2CH=CH_2$	$SCF_2CF_2CF_3$
$S(O)_2$(D-16e)	$S(O)_2CH_2CH=CH_2$	$SCF(CF_3)$
SBu-n	$SCH(Me)CH=CH_2$	SCH_2OMe
S(O)Bu-n	$SC(Me)_2CH=CH_2$	$S(CH_2)_2OMe$
$S(O)_2Bu-n$	$SCH_2CH=CHMe$	$S(O)(CH_2)_2OMe$
SBu-i	$SCH_2C(Me)=CH_2$	$S(O)_2(CH_2)_2OMe$
S(O)Bu-i	$S(CH_2)_2CH=CMe_2$	$SCH(Me)CH_2OMe$
$S(O)_2Bu-i$	$SC(Me)=CH_2$	$S(O)CH(Me)CH_2OMe$
SBu-c	SC(Me)=CH(Me)	$S(O)_2CH(Me)CH_2OMe$
S(O)Bu-c	$SCH_2C\equiv CH$	$SCH_2CH(Me)OMe$
$S(O)_2Bu-c$	$S(O)CH_2C\equiv CH$	$S(O)CH_2CH(Me)OMe$
SBu-s	$S(O)_2CH_2C\equiv CH$	$S(O)_2CH_2CH(Me)OMe$
S(O)Bu-s	$SCH(Me)C\equiv CH$	$SC(Me)_2CH_2OMe$
$S(O)_2Bu-s$	$SC(Me)_2C\equiv CH$	$S(CH_2)_3OMe$
SBu-t	$SCH_2C\equiv CMe$	SCH_2OEt
S(O)Bu-t	SCH_2Cl	$S(CH_2)_2OEt$
$S(O)_2Bu-t$	SCH(Me)Cl	$S(O)(CH_2)_2OEt$

[Tabla 10]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$S(O)_2(CH_2)_2OEt$	$S(O)_2CH_2CN$	$SCH(Me)C(O)Me$
$SCH(Me)CH_2OEt$	$SCH(Me)CN$	$S(CH_2)_2C(O)Me$
$SCH_2OPr\text{-}i$	$S(O)CH(Me)CN$	$SCH_2C(O)OMe$
$S(CH_2)_2OPr\text{-}i$	$S(O)_2CH(Me)CN$	$SCH(Me)C(O)OMe$
$S(O)(CH_2)_2OPr\text{-}i$	$SC(Me)_2CN$	$S(CH_2)_2C(O)OMe$
$S(O)_2(CH_2)_2OPr\text{-}i$	$S(O)C(Me)_2CN$	$SCH_2C(O)OEt$
$SCH(Me)CH_2OPr\text{-}i$	$S(O)_2C(Me)_2CN$	$SCH(Me)C(O)OEt$
$SCH_2Pr\text{-}c$	$S(CH_2)_2CN$	$S(CH_2)_2C(O)OEt$
$S(O)CH_2Pr\text{-}c$	$S(O)(CH_2)_2CN$	$SCH_2(D\text{-}8a)$
$S(O)_2CH_2Pr\text{-}c$	$S(O)_2(CH_2)_2CN$	$S(O)CH_2(D\text{-}8a)$
$SCH(Me)Pr\text{-}c$	SCH_2Ph	$S(O)_2CH_2(D\text{-}8a)$
$S(O)CH(Me)Pr\text{-}c$	$S(O)CH_2Ph$	$SCH_2(D\text{-}8b)$
$S(O)_2CH(Me)Pr\text{-}c$	$S(O)_2CH_2Ph$	$S(O)CH_2(D\text{-}8b)$
$S(CH_2)_2Pr\text{-}c$	$SCH(Me)Ph$	$S(O)_2CH_2(D\text{-}8b)$
$SCH_2(D\text{-}16)$	$S(O)CH(Me)Ph$	$SCH_2(D\text{-}8c)$
$S(O)CH_2(D\text{-}16)$	$S(O)_2CH(Me)Ph$	$S(O)CH_2(D\text{-}8c)$
$S(O)_2CH_2(D\text{-}16)$	$SCH_2(2\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$S(O)_2CH_2(D\text{-}8c)$
$SCH_2(D\text{-}16e)$	$S(O)CH_2(2\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$SCH_2(D\text{-}8d)$
$S(O)CH_2(D\text{-}16e)$	$S(O)_2CH_2(2\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$S(O)CH_2(D\text{-}8d)$
$S(O)_2CH_2(D\text{-}16e)$	$SCH(Me)(2\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$S(O)_2CH_2(D\text{-}8d)$
$SCH_2Bu\text{-}c$	$S(O)CH(Me)(2\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$SCH_2(D\text{-}8e)$
$S(O)CH_2Bu\text{-}c$	$S(O)_2CH(Me)(2\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$S(O)_2CH_2(D\text{-}8e)$
$S(O)_2CH_2Bu\text{-}c$	$SCH_2(3\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$SCH_2(D\text{-}8f)$
$SCH(Me)Bu\text{-}c$	$S(O)CH_2(3\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$S(O)_2CH_2(D\text{-}8f)$
$S(CH_2)_2Bu\text{-}c$	$S(O)_2CH_2(3\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$SCH_2(D\text{-}8g)$
$SCH_2Pen\text{-}c$	$SCH(Me)(3\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$S(O)_2CH_2(D\text{-}8g)$
$S(O)CH_2Pen\text{-}c$	$S(O)CH(Me)(3\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$SCH_2(D\text{-}8h)$
$S(O)_2CH_2Pen\text{-}c$	$S(O)_2CH(Me)(3\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$S(O)_2CH_2(D\text{-}8h)$
$SCH(Me)Pen\text{-}c$	$SCH_2(4\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$SCH_2(D\text{-}15)$
$S(CH_2)_2Pen\text{-}c$	$S(O)CH_2(4\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$S(O)CH_2(D\text{-}15)$
$SCH_2Hex\text{-}c$	$S(O)_2CH_2(4\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$S(O)_2CH_2(D\text{-}15)$
$SCH(Me)Hex\text{-}c$	$SCH(Me)(4\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$SCH(Me)(D\text{-}15)$
$S(CH_2)_2Hex\text{-}c$	$S(O)CH(Me)(4\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$S(O)CH(Me)(D\text{-}15)$
SCH_2CN	$S(O)_2CH(Me)(4\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$S(O)_2CH(Me)(D\text{-}15)$
$S(O)CH_2CN$	$SCH_2C(O)Me$	$S(CH_2)_2(D\text{-}15)$

[Tabla 11]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$S(O)(CH_2)_2$(D-15)	N(Me)Pr-c	N(Pr-i)Pr-i
$S(O)_2(CH_2)_2$(D-15)	N(Me)(D-16)	N(Pr-i)Pr-c
SCH_2(D-18)	N(Me)(D-16e)	N(Pr-i)(D-16)
$S(O)CH_2$(D-18)	N(Me)Bu-n	N(Pr-i)(D-16e)
$S(O)_2CH_2$(D-18)	N(Me)Bu-i	N(Pr-i)Bu-n
SCH(Me)(D-18)	N(Me)Bu-c	N(Pr-i)Bu-i
S(O)CH(Me)(D-18)	N(Me)Bu-s	N(Pr-i)Bu-c
$S(O)_2$CH(Me)(D-18)	N(Me)Bu-t	N(Pr-i)Bu-s
$S(CH_2)_2$(D-18)	N(Me)Pen-n	$NHCH_2OMe$
$S(O)(CH_2)_2$(D-18)	N(Me)Pen-i	$NHCH_2OEt$
$S(O)_2(CH_2)_2$(D-18)	N(Me)Pen-c	NHCH(Me)OMe
NHMe	N(Me)Pen-s	NHCH(Me)OEt
NHEt	N(Me)Pen-t	$NHC(Me)_2OMe$
NHPr-n	N(Me)(3-Pen)	$NHC(Me)_2OEt$
NHPr-i	N(Me)Hex-n	$NH(CH_2)_2OMe$
NHPr-c	N(Me)Hex-c	$NH(CH_2)_2OEt$
NH(D-16)	N(Et)Et	$NH(CH_2)_2OPr$-n
NH(D-16e)	N(Et)Pr-n	$NH(CH_2)_2OPr$-i
NHBu-n	N(Et)Pr-i	$N(Me)CH_2OMe$
NHBu-i	N(Et)Pr-c	$N(Me)CH_2OEt$
NHBu-c	N(Et)(D-16)	N(Me)CH(Me)OMe
NHBu-s	N(Et)(D-16e)	N(Me)CH(Me)OEt
NHBu-t	N(Et)Bu-n	$N(Me)C(Me)_2OMe$
NHPen-n	N(Et)Bu-i	$N(Me)C(Me)_2OEt$
NHPen-i	N(Et)Bu-c	$N(Me)(CH_2)_2OMe$
NHPen-c	N(Et)Bu-s	$N(Me)(CH_2)_2OEt$
NHPen-s	N(Pr-n)Pr-n	$N(Me)(CH_2)_2OPr$-n
NHPen-t	N(Pr-n)Pr-i	$N(Me)(CH_2)_2OPr$-i
NH(3-Pen)	N(Pr-n)Pr-c	$N(Et)C(Me)_2OMe$
NHHex-n	N(Pr-n)(D-16)	$N(Et)C(Me)_2OEt$
NHHex-c	N(Pr-n)(D-16e)	$N(Et)(CH_2)_2OMe$
N(Me)Me	N(Pr-n)Bu-n	$N(Et)(CH_2)_2OEt$
N(Me)Et	N(Pr-n)Bu-i	$N(Et)(CH_2)_2OPr$-n
N(Me)Pr-n	N(Pr-n)Bu-c	$N(Et)(CH_2)_2OPr$-i
N(Me)Pr-i	N(Pr-n)Bu-s	$N(Pr-n)(CH_2)_2OMe$

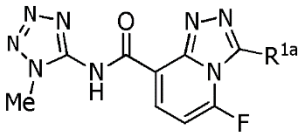
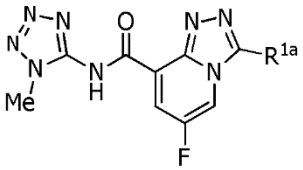
[Tabla 12]

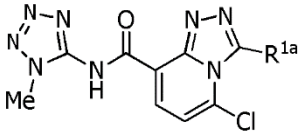
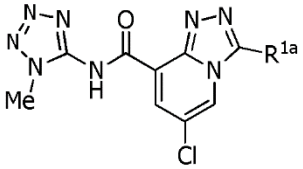
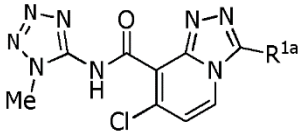
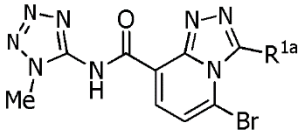
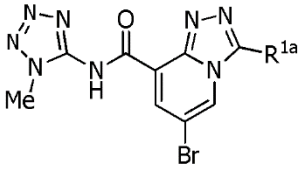
R^{1a}
N(Pr-n)$(CH_2)_2$OEt
N(Pr-n)$(CH_2)_2$OPr-n
N(Pr-n)$(CH_2)_2$OPr-i
N(Pr-i)$(CH_2)_2$OMe
N(Pr-i)$(CH_2)_2$OEt
N(Pr-i)$(CH_2)_2$OPr-n
N(Pr-i)$(CH_2)_2$OPr-i
$NHCH_2SMe$
$NHCH_2SEt$
NHCH(Me)SMe
NHCH(Me)SEt
$NHC(Me)_2SMe$
$NHC(Me)_2SEt$
$NH(CH_2)_2SMe$
$NH(CH_2)_2S(O)Me$
$NH(CH_2)_2S(O)_2Me$
$NH(CH_2)_2SEt$
$NH(CH_2)_2S(O)Et$
$NH(CH_2)_2S(O)_2Et$
$NH(CH_2)_2SPr$-i
$NH(CH_2)_2S(O)Pr$-i
$NH(CH_2)_2S(O)_2Pr$-i
$N(Me)CH_2SMe$
$N(Me)CH_2SEt$
N(Me)CH(Me)SMe
N(Me)CH(Me)SEt
$N(Me)C(Me)_2SMe$
$N(Me)C(Me)_2SEt$
$N(Me)(CH_2)_2SMe$
$N(Me)(CH_2)_2S(O)Me$
$N(Me)(CH_2)_2S(O)_2Me$
$N(Me)(CH_2)_2SEt$
$N(Me)(CH_2)_2S(O)Et$
$N(Me)(CH_2)_2S(O)_2Et$
$N(Me)(CH_2)_2SPr$-i

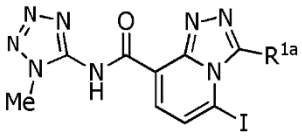
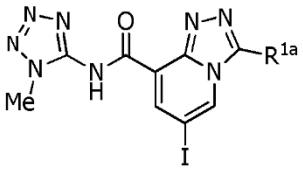
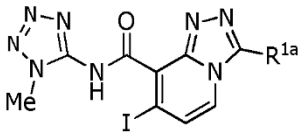
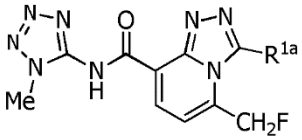
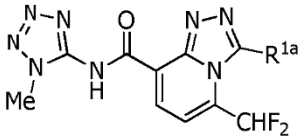
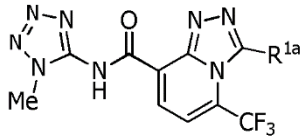
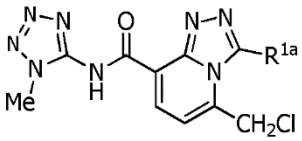
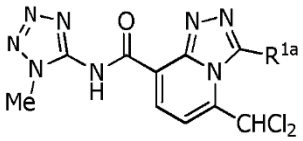
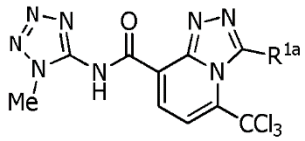
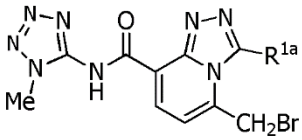
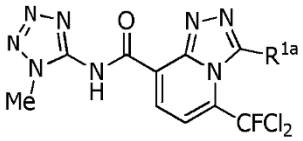
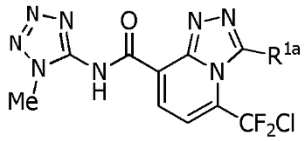
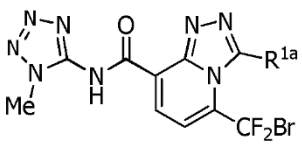
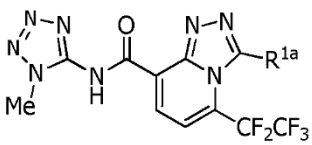
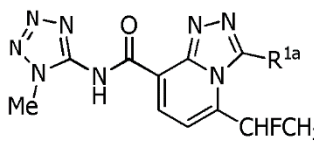
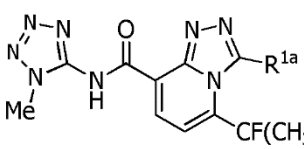
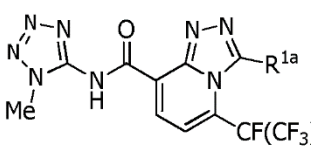
R^{1a}
$N(Me)(CH_2)_2S(O)Pr$-i
$N(Me)(CH_2)_2S(O)_2Pr$-i
$NHCF_2H$
$NHCF_3$
$NHCH_2CF_2H$
$NHCH_2CF_3$
$NH(CH_2)_2CF_3$
$NH(CH_2)_2Cl$
$NH(CH_2)_3Cl$
$N(Me)CF_2H$
$N(Me)CF_3$
$N(Me)CH_2CF_2H$
$N(Me)CH_2CF_3$
$N(Me)(CH_2)_2CF_3$
$N(Me)(CH_2)_2Cl$
$N(Me)(CH_2)_3Cl$
$NHCH_2CH{=}CH_2$
$N(Me)CH_2CH{=}CH_2$
$NHCH_2C{\equiv}CH$
$NHCH_2C{\equiv}CMe$
$N(Me)CH_2C{\equiv}CH$
$N(Me)CH_2C{\equiv}CMe$
$NHCH_2CN$
$NH(CH_2)_2CN$
$NH(CH_2)_3CN$
$N(Me)CH_2CN$
$N(Me)(CH_2)_2CN$
$N(Me)(CH_2)_3CN$
NHPh
NH(2-MeO-Ph)
NH(3-MeO-Ph)
NH(4-MeO-Ph)
NH(2,3-$(MeO)_2$-Ph)
NH(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
NH(2,5-$(MeO)_2$-Ph)

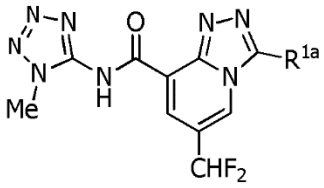
R^{1a}
NH(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
NH(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
NH(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)Ph
N(Me)(2-MeO-Ph)
N(Me)(3-MeO-Ph)
N(Me)(4-MeO-Ph)
N(Me)(2,3-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
$NHCH_2Ph$
$NHCH_2$(2-MeO-Ph)
$NHCH_2$(3-MeO-Ph)
$NHCH_2$(4-MeO-Ph)
$N(Me)CH_2Ph$
$N(Me)CH_2$(2-MeO-Ph)
$N(Me)CH_2$(3-MeO-Ph)
$N(Me)CH_2$(4-MeO-Ph)
NH(D-9b)
NH(D-9e)
NH(D-9h)
NH(D-9k)
N Me)(D-9b)
N Me)(D-9e)
N Me)(D-9h)
N Me)(D-9k)
$NHSO_2Ph$
$N(Me)SO_2Ph$

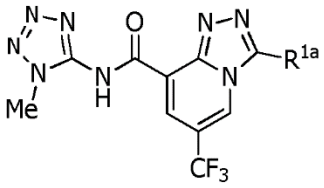
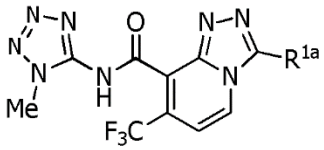
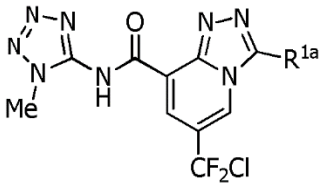
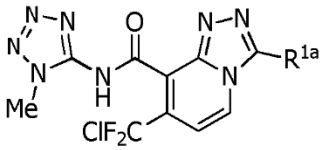
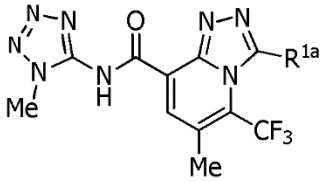
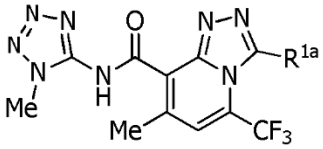
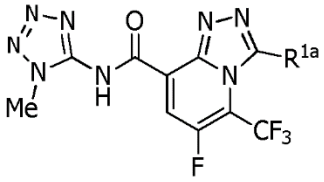
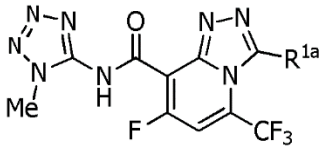
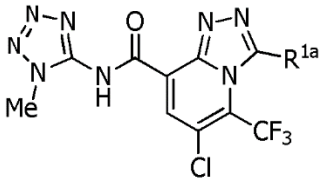
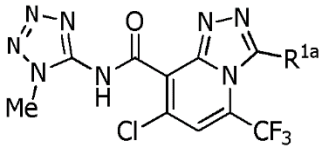
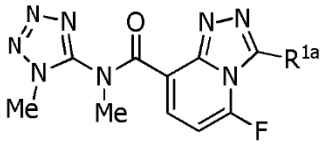
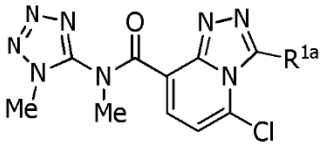
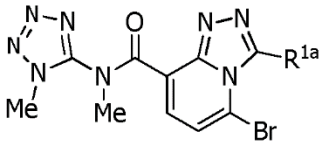
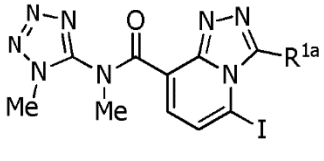
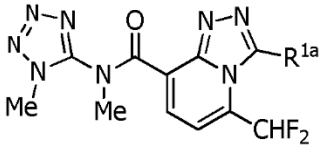
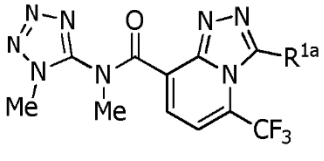
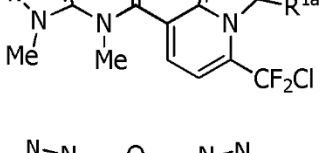
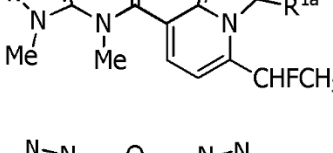
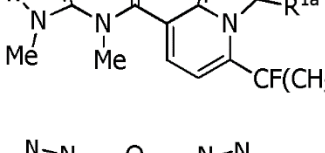
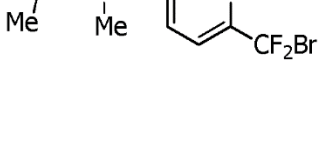
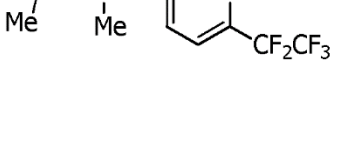
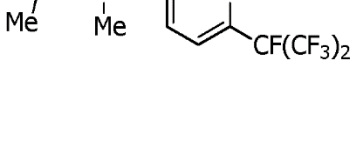
[0190] [Segunda Tabla]

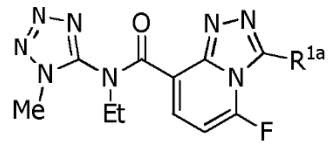
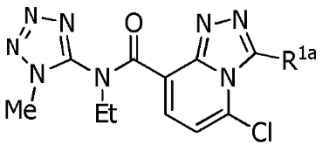
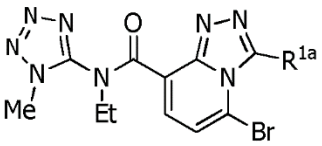
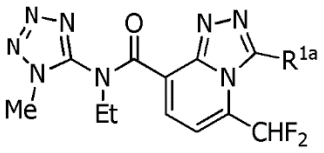
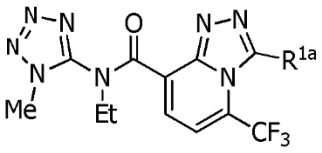
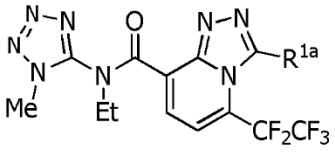
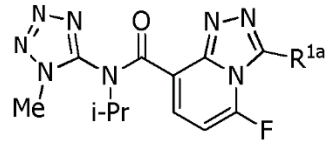
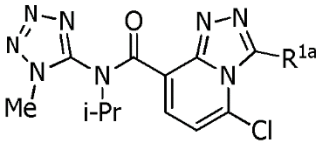
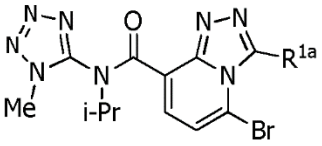
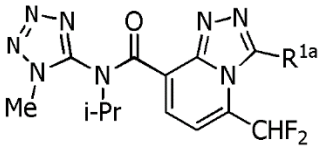
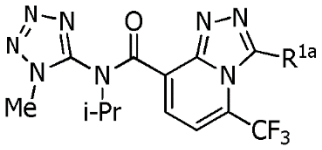
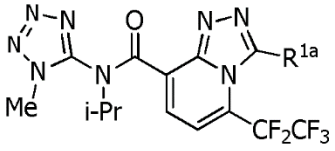
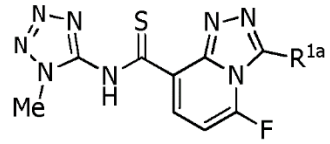
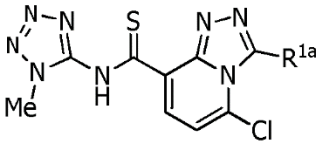
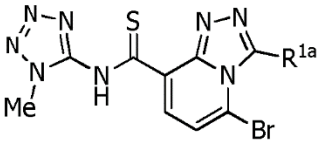
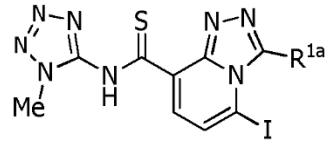
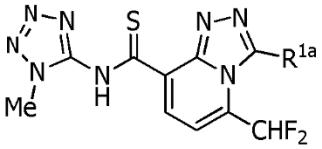
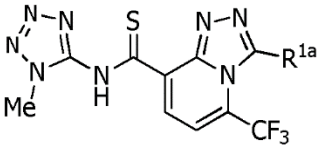
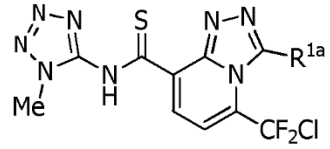
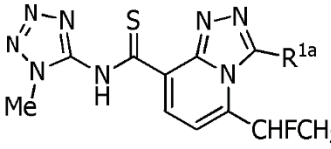
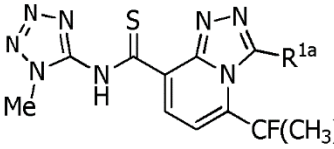
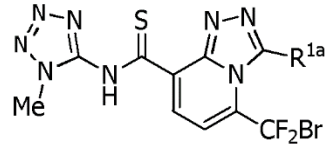
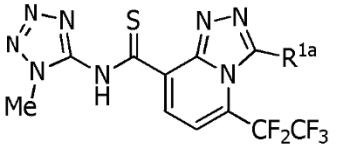
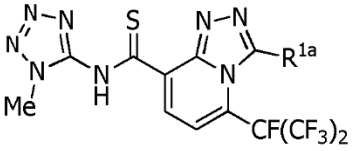



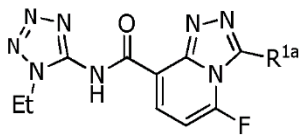
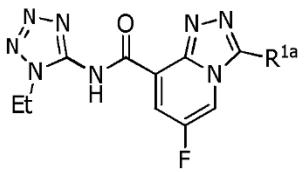
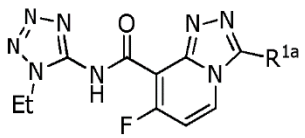
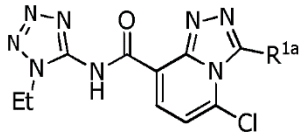
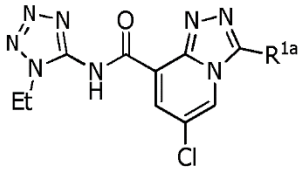
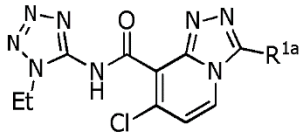
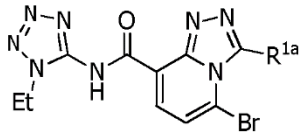
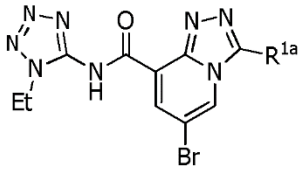
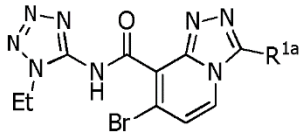
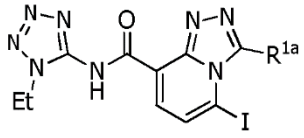
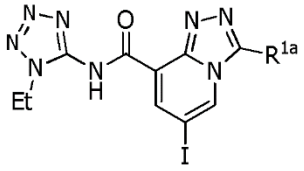
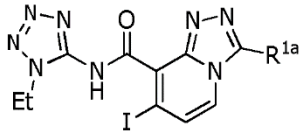
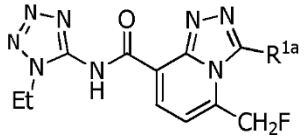
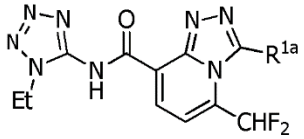
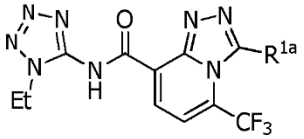
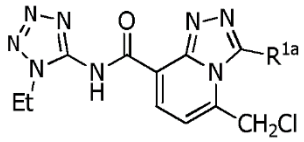
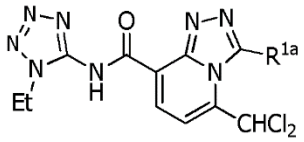
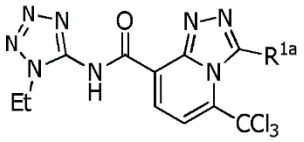
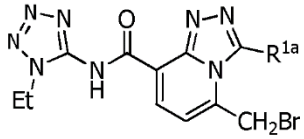
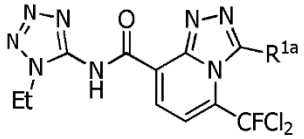
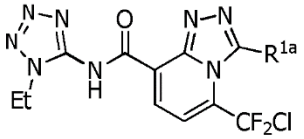
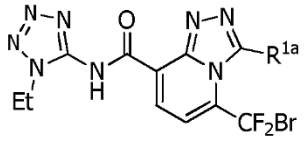
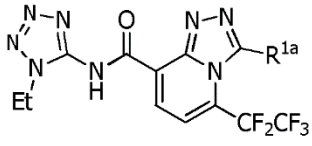
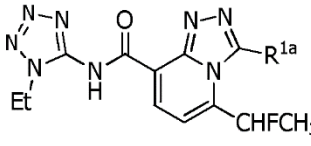
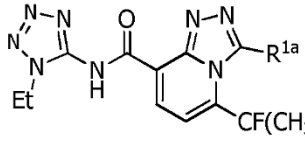
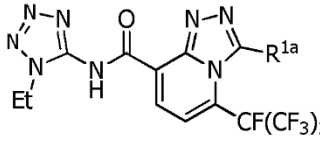






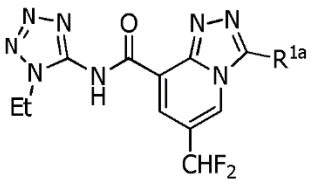
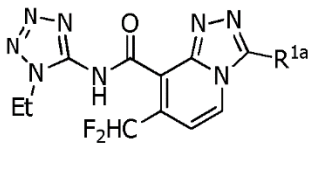
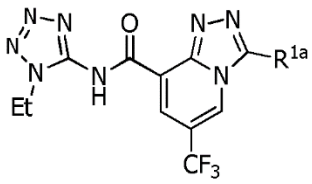
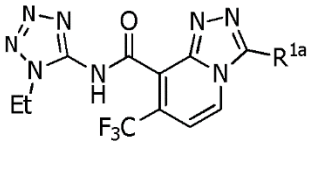
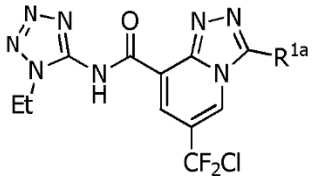
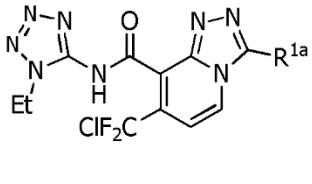
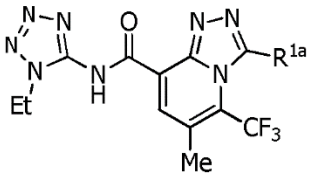
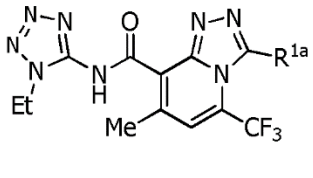
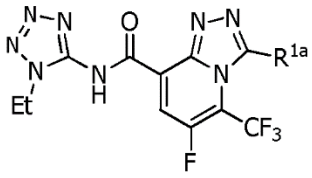
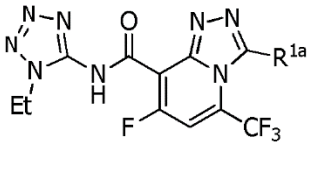
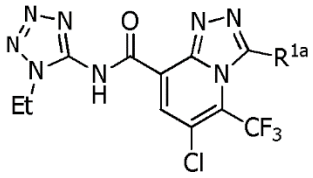
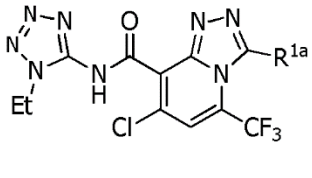
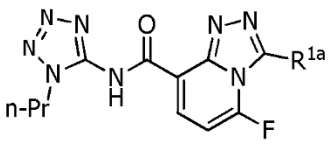
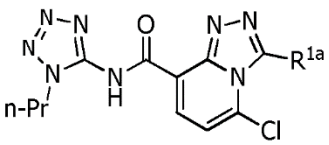
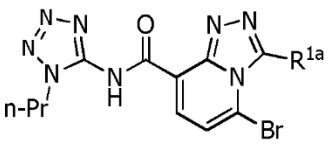
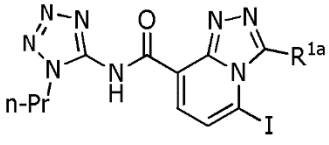
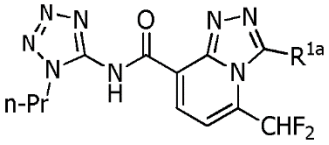
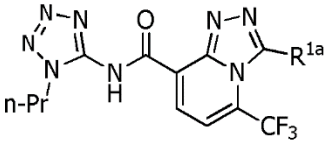
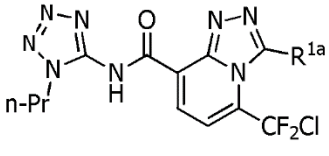
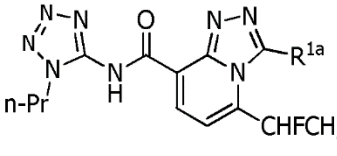
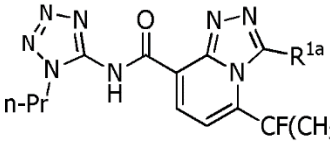
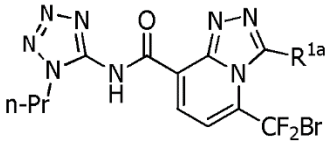
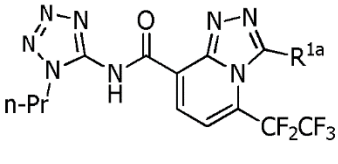
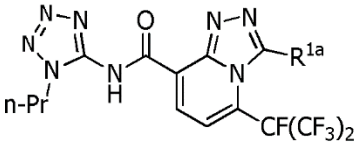


















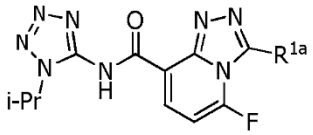
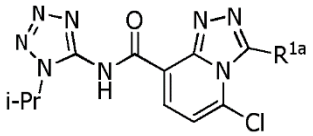
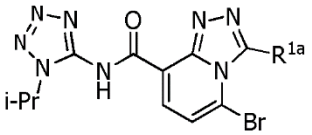
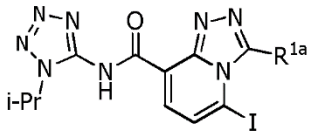
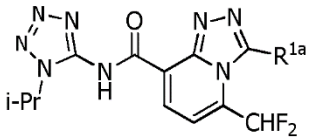
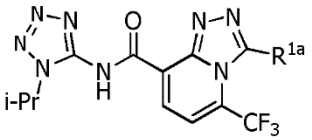
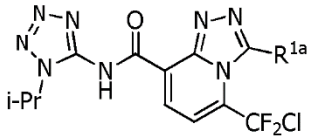
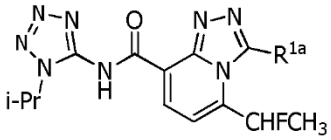
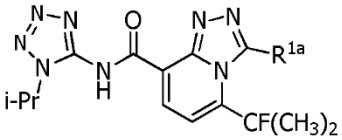
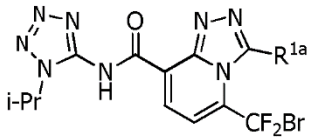
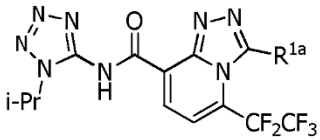
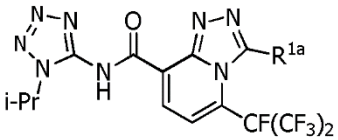
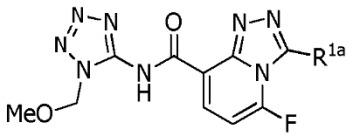
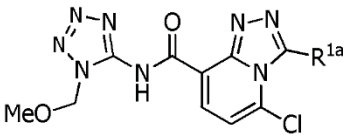
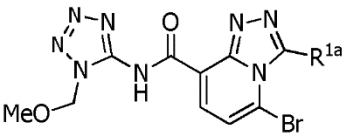
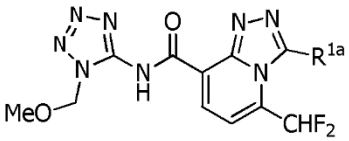
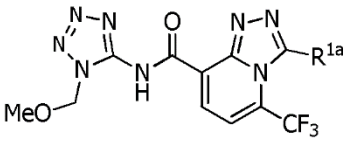
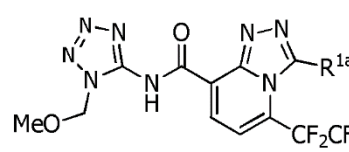
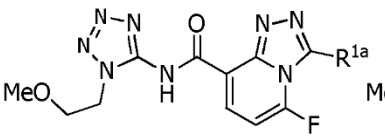
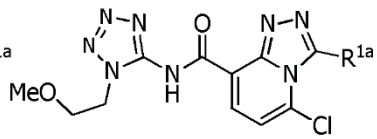
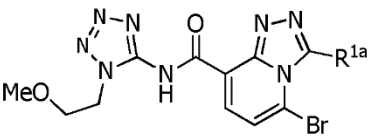
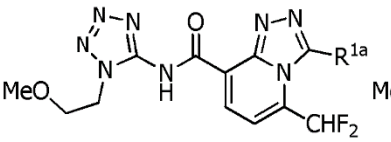
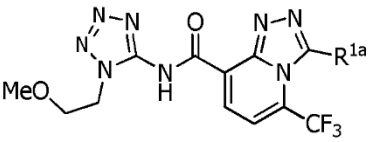
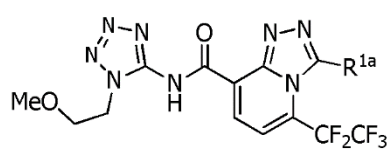


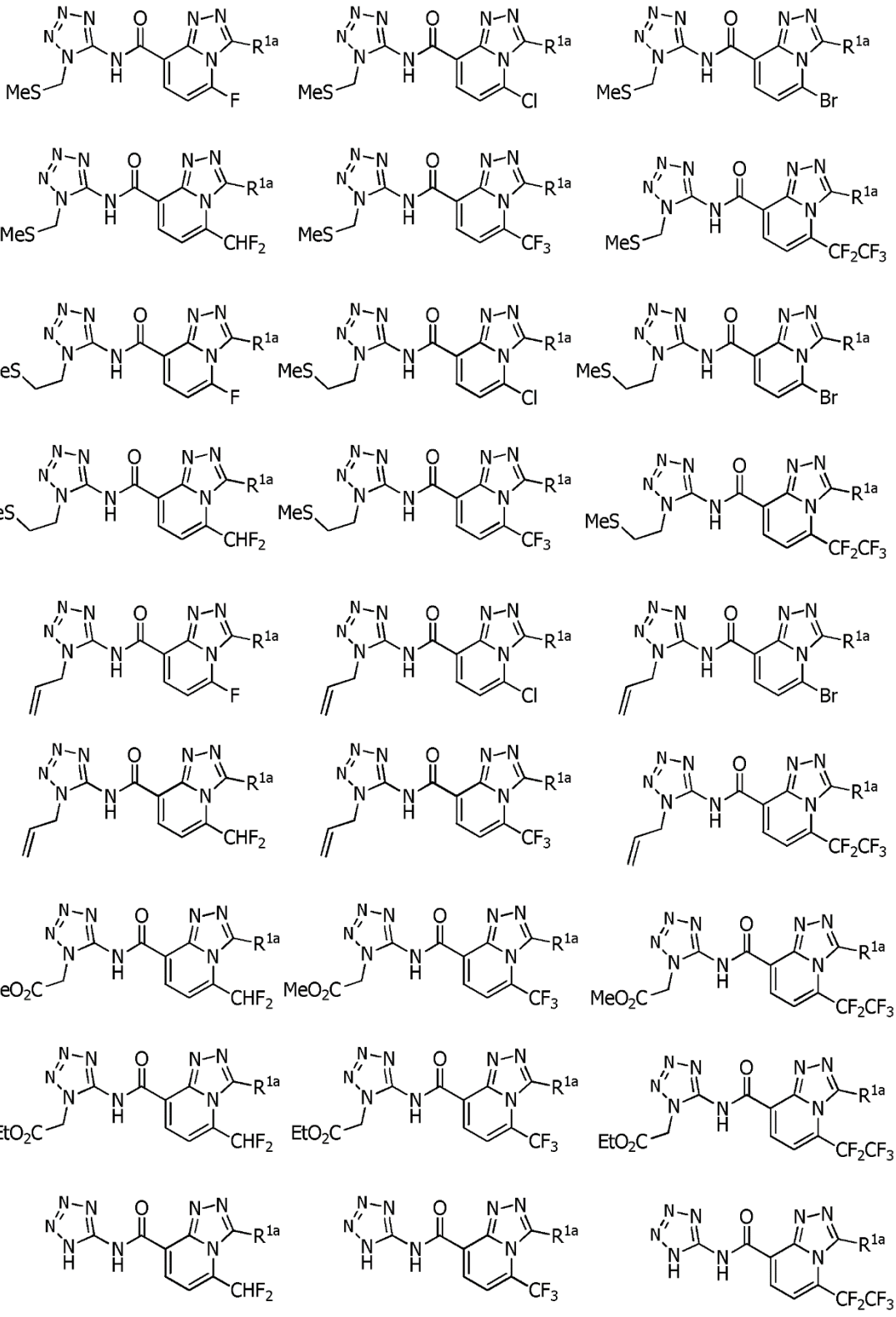























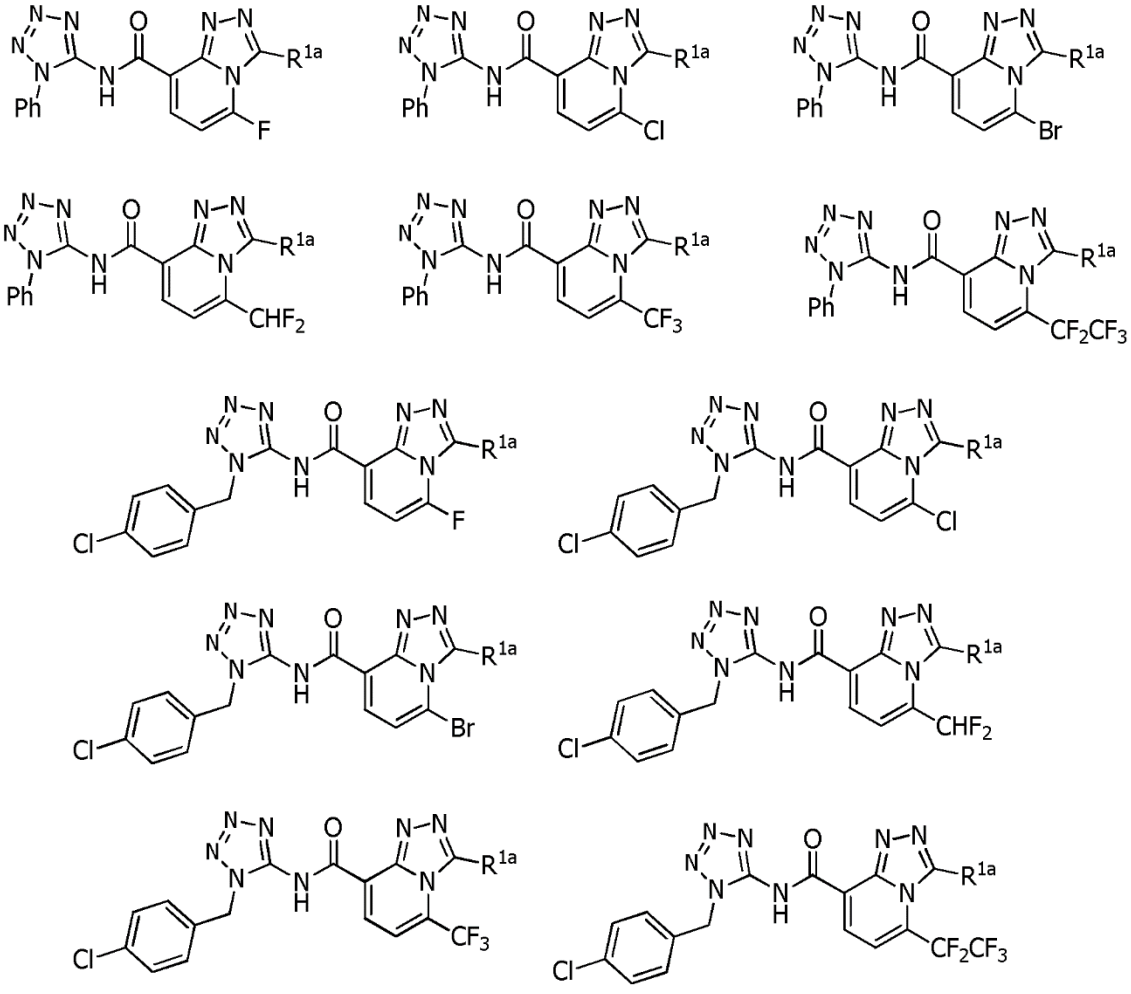





























[Tabla 13]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
H	CH_2OHex-n	$C(Me)_2OMe$
F	CH(Me)OMe	$C(Me)_2OEt$
Cl	CH(Me)OEt	$C(Me)_2OPr$-n
Br	CH(Me)OPr-n	$C(Me)_2OPr$-i
I	CH(Me)OPr-i	$C(Me)_2OBu$-n
Me	CH(Me)OBu-n	$C(Me)_2OBu$-i
Et	CH(Me)OBu-i	$C(Me)_2OBu$-s
Pr-n	CH(Me)OBu-s	$C(Me)_2OBu$-t
Pr-i	CH(Me)OBu-t	$(CH_2)_2OMe$
Pr-c	CH(Me)OPen-n	$(CH_2)_2OEt$
Bu-n	CH(Me)OPen-i	$(CH_2)_2OPr$-n
Bu-i	CH(Me)OPen-s	$(CH_2)_2OPr$-i
Bu-c	CH(Me)OPen-t	$(CH_2)_2OBu$-n
Bu-s	CH(Me)OHex-n	$(CH_2)_2OBu$-i
Bu-t	CH(Et)OMe	$(CH_2)_2OBu$-s
Pen-n	CH(Et)OEt	$(CH_2)_2OBu$-t
Pen-i	CH(Et)OPr-n	$CH(Me)CH_2OMe$
Pen-c	CH(Et)OPr-i	$CH(Me)CH_2OEt$
Pen-s	CH(Et)OBu-n	$CH(Me)CH_2OPr$-n
Pen-t	CH(Et)OBu-i	$CH(Me)CH_2OPr$-i
3-Pen	CH(Et)OBu-s	$CH(Me)CH_2OBu$-n
Hex-n	CH(Et)OBu-t	$CH(Me)CH_2OBu$-i
Hex-c	CH(Et)OPen-n	$CH(Me)CH_2OBu$-s
CH_2OMe	CH(Et)OPen-i	$CH(Me)CH_2OBu$-t
CH_2OEt	CH(Et)OPen-s	$CH(Et)CH_2OMe$
CH_2OPr-n	CH(Et)OPen-t	$CH(Et)CH_2OEt$
CH_2OPr-i	CH(Et)OHex-n	$(CH_2)_3OMe$
CH_2OBu-n	CH(Pr-n)OMe	$(CH_2)_3OEt$
CH_2OBu-i	CH(Pr-n)OEt	$(CH_2)_3OPr$-n
CH_2OBu-s	CH(Pr-n)OPr-n	$(CH_2)_3OPr$-i
CH_2OBu-t	CH(Pr-n)OPr-i	$(CH_2)_3OBu$-n
CH_2OPen-n	CH(Pr-i)OMe	$(CH_2)_3OBu$-i
CH_2OPen-i	CH(Pr-i)OEt	$(CH_2)_3OBu$-s
CH_2OPen-s	CH(Pr-i)OPr-n	$(CH_2)_3OBu$-t
CH_2OPen-t	CH(Pr-i)OPr-i	CH_2OCF_2H

[Tabla 14]

R^{1a}
CH_2OCF_3
$CH_2OCH_2CF_2H$
$CH_2OCH_2CF_3$
$CH_2O(CH_2)_2CF_3$
$CH_2O(CH_2)_2Cl$
$CH_2O(CH_2)_2Br$
$CH(Me)OCF_2H$
$CH(Me)OCF_3$
$CH(Me)OCH_2CF_2H$
$CH(Me)OCH_2CF_3$
$CH(Me)O(CH_2)_2CF_3$
$CH(Me)O(CH_2)_2Cl$
$CH(Me)O(CH_2)_2Br$
$CH(Et)OCF_2H$
$CH(Et)OCF_3$
$CH(Et)OCH_2CF_2H$
$CH(Et)OCH_2CF_3$
$CH(Et)O(CH_2)_2CF_3$
$CH(Et)O(CH_2)_2Cl$
$CH(Et)O(CH_2)_2Br$
$C(Me)_2OCF_2H$
$C(Me)_2OCF_3$
$C(Me)_2OCH_2CF_2H$
$C(Me)_2OCH_2CF_3$
$C(Me)_2O(CH_2)_2CF_3$
$C(Me)_2O(CH_2)_2Cl$
$C(Me)_2O(CH_2)_2Br$
$(CH_2)_2OCF_3$
$(CH_2)_2OCH_2CF_2H$
$(CH_2)_2OCH_2CF_3$
$(CH_2)_2O(CH_2)_2Cl$
$(CH_2)_2O(CH_2)_2Br$
CH_2OH
CH(Me)OH
CH(Et)OH

R^{1a}
CH(iPr)OH
$C(Me)_2OH$
$(CH_2)_2OH$
$CH(Me)CH_2OH$
$(CH_2)_3OH$
CH_2OCH_2OMe
CH_2OCH_2OEt
CH_2OCH_2OPr-n
CH_2OCH_2OPr-i
$CH_2O(CH_2)_2OMe$
$CH_2O(CH_2)_2OEt$
$CH_2O(CH_2)_2OPr-n$
$CH_2O(CH_2)_2OPr-i$
$CH_2OCH(Me)CH_2OMe$
$CH_2OCH(Me)CH_2OEt$
$CH_2OCH_2CH(Me)OMe$
$CH_2OCH_2CH(Me)OEt$
$CH_2OCH(Me)OMe$
$CH_2OCH(Me)OEt$
$CH_2O(CH_2)_3OMe$
$CH_2O(CH_2)_3OEt$
$CH(Me)OCH_2OMe$
$CH(Me)OCH_2OEt$
$CH(Me)OCH_2OPr-n$
$CH(Me)OCH_2OPr-i$
$CH(Me)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Me)O(CH_2)_2OEt$
$CH(Me)O(CH_2)_2OPr-n$
$CH(Me)O(CH_2)_2OPr-i$
$CH(Me)OCH(Me)CH_2OMe$
$CH(Me)OCH(Me)CH_2OEt$
$CH(Me)OCH_2CH(Me)OMe$
$CH(Me)OCH_2CH(Me)OEt$
$C(Me)_2OCH_2OMe$
$C(Me)_2OCH_2OEt$

R^{1a}
$C(Me)_2OCH_2OPr-n$
$C(Me)_2OCH_2OPr-i$
$C(Me)_2O(CH_2)_2OMe$
$C(Me)_2O(CH_2)_2OEt$
$C(Me)_2O(CH_2)_2OPr-n$
$C(Me)_2O(CH_2)_2OPr-i$
$(CH_2)_2OCH_2OMe$
$(CH_2)_2OCH_2OEt$
$(CH_2)_2OCH_2OPr-n$
$(CH_2)_2OCH_2OPr-i$
$(CH_2)_2O(CH_2)_2OMe$
$(CH_2)_2O(CH_2)_2OEt$
$(CH_2)_2O(CH_2)_2OPr-n$
$(CH_2)_2O(CH_2)_2OPr-i$
$CH(Me)CH_2OCH_2OMe$
$CH(Me)CH_2OCH_2OEt$
$CH(Me)CH_2O(CH_2)_2OMe$
$CH(Me)CH_2O(CH_2)_2OEt$
$CH(Et)CH_2OCH_2OMe$
$CH(Et)CH_2OCH_2OEt$
$CH(Et)CH_2O(CH_2)_2OMe$
$CH(Et)CH_2O(CH_2)_2OEt$
$CH(Et)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Et)O(CH_2)_2OEt$
$CH(Et)O(CH_2)_2OPr-n$
$CH(Et)O(CH_2)_2OPr-i$
$CH(Pr-n)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Pr-n)O(CH_2)_2OEt$
$CH(Pr-n)O(CH_2)_2OPr-n$
$CH(Pr-n)O(CH_2)_2OPr-i$
$CH(Pr-i)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Pr-i)O(CH_2)_2OEt$
$CH(Pr-i)O(CH_2)_2OPr-n$
$CH(Pr-i)O(CH_2)_2OPr-i$
$CH_2OC(O)Me$

[Tabla 15]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$CH_2OC(O)Et$	CH(Et)C(O)OEt	$CH_2S(O)Pen\text{-}n$
$CH_2OC(O)Pr\text{-}i$	CH(Et)C(O)OPr-i	$CH_2S(O)_2Pen\text{-}n$
CH(Me)OC(O)Me	$CH(Et)C(O)OCH_2OMe$	$CH_2SPen\text{-}i$
CH(Me)OC(O)Et	$CH(Et)C(O)O(CH_2)_2OMe$	$CH_2S(O)Pen\text{-}i$
CH(Me)OC(O)Pr-i	$CH(Et)C(O)O(CH_2)_2OEt$	$CH_2S(O)_2Pen\text{-}i$
CH(Et)OC(O)Me	$CH(Et)C(O)O(CH_2)_2OPr\text{-}i$	$CH_2SPen\text{-}s$
CH(Et)OC(O)Et	$(CH_2)_2C(O)OMe$	$CH_2S(O)Pen\text{-}s$
CH(Et)OC(O)Pr-i	$(CH_2)_2C(O)OEt$	$CH_2S(O)_2Pen\text{-}s$
CH_2OPh	$(CH_2)_2C(O)O(CH_2)_2OMe$	$CH_2SPen\text{-}t$
CH(Me)OPh	$(CH_2)_2C(O)O(CH_2)_2OEt$	$CH_2S(O)Pen\text{-}t$
$CH_2C(O)OMe$	CH_2SMe	$CH_2S(O)_2Pen\text{-}t$
$CH_2C(O)OEt$	$CH_2S(O)Me$	$CH_2SHex\text{-}n$
$CH_2C(O)OPr\text{-}n$	$CH_2S(O)_2Me$	CH(Me)SMe
$CH_2C(O)OPr\text{-}i$	CH_2SEt	CH(Me)S(O)Me
$CH_2C(O)OBu\text{-}n$	$CH_2S(O)Et$	$CH(Me)S(O)_2Me$
$CH_2C(O)OBu\text{-}i$	$CH_2S(O)_2Et$	CH(Me)SEt
$CH_2C(O)OBu\text{-}s$	$CH_2SPr\text{-}n$	CH(Me)S(O)Et
$CH_2C(O)OBu\text{-}t$	$CH_2S(O)Pr\text{-}n$	$CH(Me)S(O)_2Et$
$CH_2C(O)OPen\text{-}n$	$CH_2S(O)_2Pr\text{-}n$	CH(Me)SPr-n
$CH_2C(O)OPen\text{-}i$	$CH_2SPr\text{-}i$	CH(Me)S(O)Pr-n
$CH_2C(O)OPen\text{-}s$	$CH_2S(O)Pr\text{-}i$	$CH(Me)S(O)_2Pr\text{-}n$
$CH_2C(O)OPen\text{-}t$	$CH_2S(O)_2Pr\text{-}i$	CH(Me)SPr-i
$CH_2C(O)OHex\text{-}n$	$CH_2SBu\text{-}n$	CH(Me)S(O)Pr-i
$CH_2C(O)OCH_2OMe$	$CH_2S(O)Bu\text{-}n$	$CH(Me)S(O)_2Pr\text{-}i$
$CH_2C(O)O(CH_2)_2OMe$	$CH_2S(O)_2Bu\text{-}n$	CH(Me)SBu-n
$CH_2C(O)O(CH_2)_2OEt$	$CH_2SBu\text{-}i$	CH(Me)S(O)Bu-n
$CH_2C(O)O(CH_2)_2OPr\text{-}i$	$CH_2S(O)Bu\text{-}i$	$CH(Me)S(O)_2Bu\text{-}n$
CH(Me)C(O)OMe	$CH_2S(O)_2Bu\text{-}i$	CH(Me)SBu-i
CH(Me)C(O)OEt	$CH_2SBu\text{-}s$	CH(Me)S(O)Bu-i
CH(Me)C(O)OPr-i	$CH_2S(O)Bu\text{-}s$	$CH(Me)S(O)_2Bu\text{-}i$
$CH(Me)C(O)OCH_2OMe$	$CH_2S(O)_2Bu\text{-}s$	CH(Me)SBu-s
$CH(Me)C(O)O(CH_2)_2OMe$	$CH_2SBu\text{-}t$	CH(Me)S(O)Bu-s
$CH(Me)C(O)O(CH_2)_2OEt$	$CH_2S(O)Bu\text{-}t$	$CH(Me)S(O)_2Bu\text{-}s$
$CH(Me)C(O)O(CH_2)_2OPr\text{-}i$	$CH_2S(O)_2Bu\text{-}t$	CH(Me)SBu-t
CH(Et)C(O)OMe	$CH_2SPen\text{-}n$	CH(Me)S(O)Bu-t

[Tabla 16]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$CH(Me)S(O)_2Bu\text{-}t$	$C(Me)_2SBu\text{-}t$	$CH(Me)CH_2S(O)_2Me$
$CH(Me)SPen\text{-}n$	$C(Me)_2S(O)Bu\text{-}t$	$CH(Me)CH_2SEt$
$CH(Me)S(O)Pen\text{-}n$	$C(Me)_2S(O)_2Bu\text{-}t$	$CH(Me)CH_2S(O)Et$
$CH(Me)S(O)_2Pen\text{-}n$	$C(Me)_2SPen\text{-}n$	$CH(Me)CH_2S(O)_2Et$
$CH(Me)SPen\text{-}i$	$C(Me)_2S(O)Pen\text{-}n$	$CH(Me)CH_2SPr\text{-}n$
$CH(Me)S(O)Pen\text{-}i$	$C(Me)_2S(O)_2Pen\text{-}n$	$CH(Me)CH_2S(O)Pr\text{-}n$
$CH(Me)S(O)_2Pen\text{-}i$	$C(Me)_2SPen\text{-}i$	$CH(Me)CH_2S(O)_2Pr\text{-}n$
$CH(Me)SPen\text{-}s$	$C(Me)_2S(O)Pen\text{-}i$	$CH(Me)CH_2SPr\text{-}i$
$CH(Me)S(O)Pen\text{-}s$	$C(Me)_2S(O)_2Pen\text{-}i$	$CH(Me)CH_2S(O)Pr\text{-}i$
$CH(Me)S(O)_2Pen\text{-}s$	$C(Me)_2SPen\text{-}s$	$CH(Me)CH_2S(O)_2Pr\text{-}i$
$CH(Me)SPen\text{-}t$	$C(Me)_2S(O)Pen\text{-}s$	$CH(Et)CH_2SMe$
$CH(Me)S(O)Pen\text{-}t$	$C(Me)_2S(O)_2Pen\text{-}s$	$CH(Et)CH_2S(O)Me$
$CH(Me)S(O)_2Pen\text{-}t$	$C(Me)_2SPen\text{-}t$	$CH(Et)CH_2S(O)_2Me$
$CH(Me)SHex\text{-}n$	$C(Me)_2S(O)Pen\text{-}t$	$CH(Et)CH_2SEt$
$C(Me)_2SMe$	$C(Me)_2S(O)_2Pen\text{-}t$	$CH(Et)CH_2S(O)Et$
$C(Me)_2S(O)Me$	$(CH_2)_2SMe$	$CH(Et)CH_2S(O)_2Et$
$C(Me)_2S(O)_2Me$	$(CH_2)_2S(O)Me$	$C(Me)_2CH_2SMe$
$C(Me)_2SEt$	$(CH_2)_2S(O)_2Me$	$C(Me)_2CH_2S(O)Me$
$C(Me)_2S(O)Et$	$(CH_2)_2SEt$	$C(Me)_2CH_2S(O)_2Me$
$C(Me)_2S(O)_2Et$	$(CH_2)_2S(O)Et$	$C(Me)_2CH_2SEt$
$C(Me)_2SPr\text{-}n$	$(CH_2)_2S(O)_2Et$	$C(Me)_2CH_2S(O)Et$
$C(Me)_2S(O)Pr\text{-}n$	$(CH_2)_2SPr\text{-}n$	$C(Me)_2CH_2S(O)_2Et$
$C(Me)_2S(O)_2Pr\text{-}n$	$(CH_2)_2S(O)Pr\text{-}n$	$C(Me)_2CH_2SPr\text{-}n$
$C(Me)_2SPr\text{-}i$	$(CH_2)_2S(O)_2Pr\text{-}n$	$C(Me)_2CH_2S(O)Pr\text{-}n$
$C(Me)_2S(O)Pr\text{-}i$	$(CH_2)_2SPr\text{-}i$	$C(Me)_2CH_2S(O)_2Pr\text{-}n$
$C(Me)_2S(O)_2Pr\text{-}i$	$(CH_2)_2S(O)Pr\text{-}i$	$C(Me)_2CH_2SPr\text{-}i$
$C(Me)_2SBu\text{-}n$	$(CH_2)_2S(O)_2Pr\text{-}i$	$C(Me)_2CH_2S(O)Pr\text{-}i$
$C(Me)_2S(O)Bu\text{-}n$	$(CH_2)_3SMe$	$C(Me)_2CH_2S(O)_2Pr\text{-}i$
$C(Me)_2S(O)_2Bu\text{-}n$	$(CH_2)_3S(O)Me$	$CH(Et)SMe$
$C(Me)_2SBu\text{-}i$	$(CH_2)_3S(O)_2Me$	$CH(Et)S(O)Me$
$C(Me)_2S(O)Bu\text{-}i$	$(CH_2)_3SEt$	$CH(Et)S(O)_2Me$
$C(Me)_2S(O)_2Bu\text{-}i$	$(CH_2)_3S(O)Et$	$CH(Et)SEt$
$C(Me)_2SBu\text{-}s$	$(CH_2)_3S(O)_2Et$	$CH(Et)S(O)Et$
$C(Me)_2S(O)Bu\text{-}s$	$CH(Me)CH_2SMe$	$CH(Et)S(O)_2Et$
$C(Me)_2S(O)_2Bu\text{-}s$	$CH(Me)CH_2S(O)Me$	$CH(Et)SPr\text{-}n$

[Tabla 17]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
CH(Et)S(O)Pr-n	$CH_2SCH_2CF_2H$	$CH(Me)S(O)(CH_2)_2CF_3$
CH(Et)$S(O)_2$Pr-n	$CH_2S(O)CH_2CF_2H$	$CH(Me)S(O)_2(CH_2)_2CF_3$
CH(Et)SPr-i	$CH_2S(O)_2CH_2CF_2H$	$CH(Me)S(CH_2)_2Cl$
CH(Et)S(O)Pr-i	$CH_2SCH_2CF_3$	$CH(Me)S(O)(CH_2)_2Cl$
CH(Et)$S(O)_2$Pr-i	$CH_2S(O)CH_2CF_3$	$CH(Me)S(O)_2(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-n)SMe	$CH_2S(O)_2CH_2CF_3$	$CH(Me)S(CH_2)_2Br$
CH(Pr-n)S(O)Me	$CH_2S(CH_2)_2CF_3$	$CH(Me)S(O)(CH_2)_2Br$
CH(Pr-n)$S(O)_2$Me	$CH_2S(O)(CH_2)_2CF_3$	$CH(Me)S(O)_2(CH_2)_2Br$
CH(Pr-n)SEt	$CH_2S(O)_2(CH_2)_2CF_3$	$C(Me)_2SCF_2H$
CH(Pr-n)S(O)Et	$CH_2S(CH_2)_2Cl$	$C(Me)_2S(O)CF_2H$
CH(Pr-n)$S(O)_2$Et	$CH_2S(O)(CH_2)_2Cl$	$C(Me)_2S(O)_2CF_2H$
CH(Pr-n)SPr-n	$CH_2S(O)_2(CH_2)_2Cl$	$C(Me)_2SCF_3$
CH(Pr-n)S(O)Pr-n	$CH_2S(CH_2)_2Br$	$C(Me)_2S(O)CF_3$
CH(Pr-n)$S(O)_2$Pr-n	$CH_2S(O)(CH_2)_2Br$	$C(Me)_2S(O)_2CF_3$
CH(Pr-n)SPr-i	$CH_2S(O)_2(CH_2)_2Br$	$C(Me)_2SCH_2CF_2H$
CH(Pr-n)S(O)Pr-i	$CH_2SCHFCH_3$	$C(Me)_2S(O)CH_2CF_2H$
CH(Pr-n)$S(O)_2$Pr-i	$CH_2SCF_2CH_3$	$C(Me)_2S(O)_2CH_2CF_2H$
CH(Pr-i)SMe	$CH_2SCF(CH_3)_2$	$C(Me)_2SCH_2CF_3$
CH(Pr-i)S(O)Me	$CH_2SCF_2CF_2H$	$C(Me)_2S(O)CH_2CF_3$
CH(Pr-i)$S(O)_2$Me	$CH_2SCF_2CF_3$	$C(Me)_2S(O)_2CH_2CF_3$
CH(Pr-i)SEt	$CH_2SCF_2CF_2CF_3$	$C(Me)_2S(CH_2)_2CF_3$
CH(Pr-i)S(O)Et	$CH_2SCF(CF_3)_2$	$C(Me)_2S(O)(CH_2)_2CF_3$
CH(Pr-i)$S(O)_2$Et	$CH(Me)SCF_2H$	$C(Me)_2S(O)_2(CH_2)_2CF_3$
CH(Pr-i)SPr-n	$CH(Me)S(O)CF_2H$	$C(Me)_2S(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-i)S(O)Pr-n	$CH(Me)S(O)_2CF_2H$	$C(Me)_2S(O)(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-i)$S(O)_2$Pr-n	$CH(Me)SCF_3$	$C(Me)_2S(O)_2(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-i)SPr-i	$CH(Me)S(O)CF_3$	$C(Me)_2S(CH_2)_2Br$
CH(Pr-i)S(O)Pr-i	$CH(Me)S(O)_2CF_3$	$C(Me)_2S(O)(CH_2)_2Br$
CH(Pr-i)$S(O)_2$Pr-i	$CH(Me)SCH_2CF_2H$	$C(Me)_2S(O)_2(CH_2)_2Br$
CH_2SCF_2H	$CH(Me)S(O)CH_2CF_2H$	$(CH_2)_2SCF_3$
$CH_2S(O)CF_2H$	$CH(Me)S(O)_2CH_2CF_2H$	$(CH_2)_2S(O)CF_3$
$CH_2S(O)_2CF_2H$	$CH(Me)SCH_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)_2CF_3$
CH_2SCF_3	$CH(Me)S(O)CH_2CF_3$	$(CH_2)_2SCH_2CF_2H$
$CH_2S(O)CF_3$	$CH(Me)S(O)_2CH_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)CH_2CF_2H$
$CH_2S(O)_2CF_3$	$CH(Me)S(CH_2)_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)_2CH_2CF_2H$

[Tabla 18]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$(CH_2)_2SCH_2CF_3$	3-Cl-Ph	2-Cl-3-Me-Ph
$(CH_2)_2S(O)CH_2CF_3$	4-Cl-Ph	2-Cl-4-Me-Ph
$(CH_2)_2S(O)_2CH_2CF_3$	2-Br-Ph	2-Cl-5-Me-Ph
$(CH_2)_2S(CH_2)_2Cl$	3-Br-Ph	3-Cl-4-Me-Ph
$(CH_2)_2S(O)(CH_2)_2Cl$	4-Br-Ph	3-Cl-5-Me-Ph
$(CH_2)_2S(O)_2(CH_2)_2Cl$	2-Me-Ph	2-Cl-3-F-Ph
$(CH_2)_2S(CH_2)_2Br$	3-Me-Ph	2-Cl-4-F-Ph
$(CH_2)_2S(O)(CH_2)_2Br$	4-Me-Ph	2-Cl-5-F-Ph
$(CH_2)_2S(O)_2(CH_2)_2Br$	2-MeO-Ph	3-Cl-4-F-Ph
$CH=CH_2$	3-MeO-Ph	3-Cl-5-F-Ph
CH=CHMe	4-MeO-Ph	2-F-3-Me-Ph
$CH=CMe_2$	2,3-$(F)_2$-Ph	2-F-4-Me-Ph
$CH_2CH=CH_2$	2,4-$(F)_2$-Ph	2-F-5-Me-Ph
$CH_2CH=CHMe$	2,5-$(F)_2$-Ph	3-F-4-Me-Ph
$CH_2C(Me)=CH_2$	2,6-$(F)_2$-Ph	3-F-5-Me-Ph
$(CH_2)_2CH=CMe_2$	3,4-$(F)_2$-Ph	2-F-3-Cl-Ph
$C(Me)=CH_2$	3,5-$(F)_2$-Ph	2-F-4-Cl-Ph
C(Me)=CHMe	2,3-$(Cl)_2$-Ph	2-F-5-Cl-Ph
$C(Me)=CMe_2$	2,4-$(Cl)_2$-Ph	3-F-4-Cl-Ph
$CH(Me)CH=CH_2$	2,5-$(Cl)_2$-Ph	3-F-5-Cl-Ph
$C(Et)=CH_2$	2,6-$(Cl)_2$-Ph	2-Me-3-F-Ph
C(Et)=CHMe	3,4-$(Cl)_2$-Ph	2-Me-4-F-Ph
$C(Et)=CMe_2$	3,5-$(Cl)_2$-Ph	2-Me-5-F-Ph
$CH(Et)CH=CH_2$	2,3-$(Me)_2$-Ph	3-Me-4-F-Ph
C≡CH	2,4-$(Me)_2$-Ph	3-Me-5-F-Ph
C≡CMe	2,5-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-3-MeO-Ph
$CH_2C≡CH$	2,6-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-4-MeO-Ph
$CH_2C≡CMe$	3,4-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-5-MeO-Ph
CH(Me)C≡CH	3,5-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-6-MeO-Ph
CH(Me)C≡CMe	2,3-$(MeO)_2$-Ph	3-Cl-4-MeO-Ph
Ph	2,4-$(MeO)_2$-Ph	3-Cl-5-MeO-Ph
2-F-Ph	2,5-$(MeO)_2$-Ph	2-F-3-MeO-Ph
3-F-Ph	2,6-$(MeO)_2$-Ph	2-F-4-MeO-Ph
4-F-Ph	3,4-$(MeO)_2$-Ph	2-F-5-MeO-Ph
2-Cl-Ph	3,5-$(MeO)_2$-Ph	2-F-6-MeO-Ph

[Tabla 19]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
3-F-4-MeO-Ph	D-8	CH_2(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
3-F-5-MeO-Ph	D-8a	CH_2(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-3-F-Ph	D-8b	CH_2(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-4-F-Ph	D-8c	CH_2(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-5-F-Ph	D-8d	CH_2(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-6-F-Ph	D-8e	CH(Me)(2-MeO-Ph)
3-MeO-4-F-Ph	D-8f	CH(Me)(3-MeO-Ph)
3-MeO-5-F-Ph	D-8g	CH(Me)(4-MeO-Ph)
2-MeO-3-Cl-Ph	D-8h	CH(Me)(2,3-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-4-Cl-Ph	D-10a	CH(Me)(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-5-Cl-Ph	D-11	CH(Me)(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-6-Cl-Ph	D-14	CH(Me)(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
3-MeO-4-Cl-Ph	D-16	CH(Me)(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
3-MeO-5-Cl-Ph	D-16a	CH(Me)(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
2-Me-3-MeO-Ph	D-16b	CH(Et)(2-MeO-Ph)
2-Me-4-MeO-Ph	D-16c	CH(Et)(3-MeO-Ph)
2-Me-5-MeO-Ph	D-16d	CH(Et)(4-MeO-Ph)
2-Me-6-MeO-Ph	D-16e	$(CH_2)_2$(2-MeO-Ph)
3-Me-4-MeO-Ph	D-16f	$(CH_2)_2$(3-MeO-Ph)
3-Me-5-MeO-Ph	D-16g	$(CH_2)_2$(4-MeO-Ph)
2-MeO-3-Me-Ph	D-16h	CHO
2-MeO-4-Me-Ph	D-16i	SMe
2-MeO-5-Me-Ph	D-16j	S(O)Me
2-MeO-6-Me-Ph	D-16k	$S(O)_2$Me
3-MeO-4-Me-Ph	D-16m	SEt
3-MeO-5-Me-Ph	D-16n	S(O)Et
3,5-$(F)_2$-4-Me-Ph	D-16p	$S(O)_2$Et
3,5-$(F)_2$-4-MeO-Ph	D-17	SPr-n
3,4,5-$(MeO)_3$-Ph	D-17a	S(O)Pr-n
D-3	D-17b	$S(O)_2$Pr-n
D-3a	CH_2Ph	SPr-i
D-4	CH_2(2-MeO-Ph)	S(O)Pr-i
D-4a	CH_2(3-MeO-Ph)	$S(O)_2$Pr-i
D-4b	CH_2(4-MeO-Ph)	SPr-c
D-5	CH_2(2,3-$(MeO)_2$-Ph)	S(O)Pr-c

[Tabla 20]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$S(O)_2Pr-c$	S(O)Pen-t	$SCHFCH_3$
S(D-16)	$S(O)_2Pen-t$	SCF_2CH_3
S(O)(D-16)	SHex-n	$SCF(CH_3)_2$
$S(O)_2$(D-16)	SHex-c	SCF_2CF_2H
S(D-16e)	$SCH_2CH=CH_2$	SCF_2CF_3
S(O)(D-16e)	$S(O)CH_2CH=CH_2$	$SCF_2CF_2CF_3$
$S(O)_2$(D-16e)	$S(O)_2CH_2CH=CH_2$	$SCF(CF_3)$
SBu-n	$SCH(Me)CH=CH_2$	SCH_2OMe
S(O)Bu-n	$SC(Me)_2CH=CH_2$	$S(CH_2)_2OMe$
$S(O)_2Bu-n$	$SCH_2CH=CHMe$	$S(O)(CH_2)_2OMe$
SBu-i	$SCH_2C(Me)=CH_2$	$S(O)_2(CH_2)_2OMe$
S(O)Bu-i	$S(CH_2)_2CH=CMe_2$	$SCH(Me)CH_2OMe$
$S(O)_2Bu-i$	$SC(Me)=CH_2$	$S(O)CH(Me)CH_2OMe$
SBu-c	SC(Me)=CH(Me)	$S(O)_2CH(Me)CH_2OMe$
S(O)Bu-c	$SCH_2C\equiv CH$	$SCH_2CH(Me)OMe$
$S(O)_2Bu-c$	$S(O)CH_2C\equiv CH$	$S(O)CH_2CH(Me)OMe$
SBu-s	$S(O)_2CH_2C\equiv CH$	$S(O)_2CH_2CH(Me)OMe$
S(O)Bu-s	$SCH(Me)C\equiv CH$	$SC(Me)_2CH_2OMe$
$S(O)_2Bu-s$	$SC(Me)_2C\equiv CH$	$S(CH_2)_3OMe$
SBu-t	$SCH_2C\equiv CMe$	SCH_2OEt
S(O)Bu-t	SCH_2Cl	$S(CH_2)_2OEt$
$S(O)_2Bu-t$	SCH(Me)Cl	$S(O)(CH_2)_2OEt$
SPen-n	$S(CH_2)_2Cl$	$S(O)_2(CH_2)_2OEt$
S(O)Pen-n	$S(O)(CH_2)_2Cl$	$SCH(Me)CH_2OEt$
$S(O)_2Pen-n$	$S(O)_2(CH_2)_2Cl$	SCH_2OPr-i
SPen-i	$SCH(Me)CH_2Cl$	$S(CH_2)_2OPr-i$
S(O)Pen-i	$SCH_2CH(Me)Cl$	$S(O)(CH_2)_2OPr-i$
$S(O)_2Pen-i$	$S(CH_2)_3Cl$	$S(O)_2(CH_2)_2OPr-i$
SPen-c	SCF_3	$SCH(Me)CH_2OPr-i$
S(O)Pen-c	SCH_2CF_3	SCH_2Pr-c
$S(O)_2Pen-c$	$S(O)CH_2CF_3$	$S(O)CH_2Pr-c$
SPen-s	$S(O)_2CH_2CF_3$	$S(O)_2CH_2Pr-c$
S(O)Pen-s	$SCH(Me)CF_3$	SCH(Me)Pr-c
$S(O)_2Pen-s$	$S(CH_2)_2CF_3$	S(O)CH(Me)Pr-c
SPen-t	$S(CH_2)_3CF_3$	$S(O)_2CH(Me)Pr-c$

[Tabla 21]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$S(CH_2)_2Pr$-c	SCH(Me)Ph	SCH_2(D-8f)
SCH_2(D-16)	S(O)CH(Me)Ph	$S(O)_2CH_2$(D-8f)
$S(O)CH_2$(D-16)	$S(O)_2CH$(Me)Ph	SCH_2(D-8g)
$S(O)_2CH_2$(D-16)	SCH_2(2-MeO-Ph)	$S(O)_2CH_2$(D-8g)
SCH_2(D-16e)	$S(O)CH_2$(2-MeO-Ph)	SCH_2(D-8h)
$S(O)CH_2$(D-16e)	$S(O)_2CH_2$(2-MeO-Ph)	$S(O)_2CH_2$(D-8h)
$S(O)_2CH_2$(D-16e)	SCH(Me)(2-MeO-Ph)	SCH_2(D-15)
SCH_2Bu-c	S(O)CH(Me)(2-MeO-Ph)	$S(O)CH_2$(D-15)
$S(O)CH_2$Bu-c	$S(O)_2CH$(Me)(2-MeO-Ph)	$S(O)_2CH_2$(D-15)
$S(O)_2CH_2$Bu-c	SCH_2(3-MeO-Ph)	SCH(Me)(D-15)
SCH(Me)Bu-c	$S(O)CH_2$(3-MeO-Ph)	S(O)CH(Me)(D-15)
$S(CH_2)_2$Bu-c	$S(O)_2CH_2$(3-MeO-Ph)	$S(O)_2CH$(Me)(D-15)
SCH_2Pen-c	SCH(Me)(3-MeO-Ph)	$S(CH_2)_2$(D-15)
$S(O)CH_2$Pen-c	S(O)CH(Me)(3-MeO-Ph)	$S(O)(CH_2)_2$(D-15)
$S(O)_2CH_2$Pen-c	$S(O)_2CH$(Me)(3-MeO-Ph)	$S(O)_2(CH_2)_2$(D-15)
SCH(Me)Pen-c	SCH_2(4-MeO-Ph)	NHMe
$S(CH_2)_2$Pen-c	$S(O)CH_2$(4-MeO-Ph)	NHEt
SCH_2Hex-c	$S(O)_2CH_2$(4-MeO-Ph)	NHPr-n
SCH(Me)Hex-c	SCH(Me)(4-MeO-Ph)	NHPr-i
$S(CH_2)_2$Hex-c	S(O)CH(Me)(4-MeO-Ph)	NHPr-c
SCH_2CN	$S(O)_2CH$(Me)(4-MeO-Ph)	NH(D-16)
$S(O)CH_2CN$	SCH_2(D-8a)	NH(D-16e)
$S(O)_2CH_2CN$	$S(O)CH_2$(D-8a)	NHBu-n
SCH(Me)CN	$S(O)_2CH_2$(D-8a)	NHBu-i
S(O)CH(Me)CN	SCH_2(D-8b)	NHBu-c
$S(O)_2CH$(Me)CN	$S(O)CH_2$(D-8b)	NHBu-s
$SC(Me)_2CN$	$S(O)_2CH_2$(D-8b)	NHBu-t
$S(O)C(Me)_2CN$	SCH_2(D-8c)	NHPen-n
$S(O)_2C(Me)_2CN$	$S(O)CH_2$(D-8c)	NHPen-i
$S(CH_2)_2CN$	$S(O)_2CH_2$(D-8c)	NHPen-c
$S(O)(CH_2)_2CN$	SCH_2(D-8d)	NHPen-s
$S(O)_2(CH_2)_2CN$	$S(O)CH_2$(D-8d)	NHPen-t
SCH_2Ph	$S(O)_2CH_2$(D-8d)	NH(3-Pen)
$S(O)CH_2Ph$	SCH_2(D-8e)	NHHex-n
$S(O)_2CH_2Ph$	$S(O)_2CH_2$(D-8e)	NHHex-c

[Tabla 22]

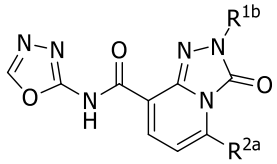
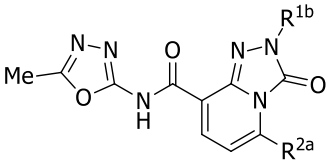
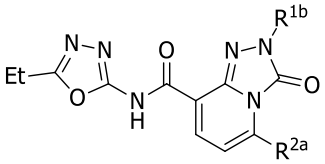
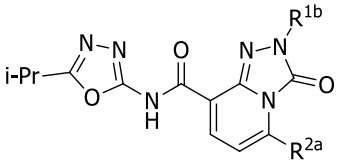
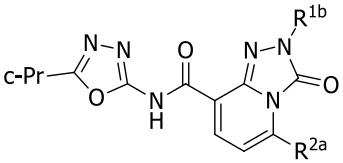
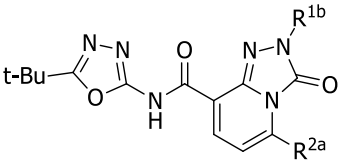
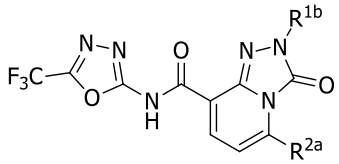
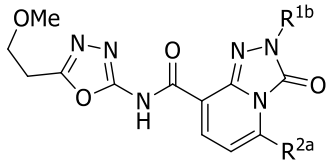
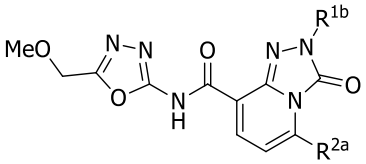
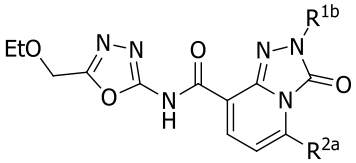
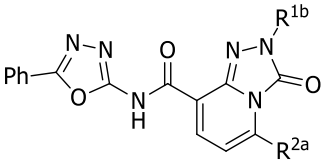
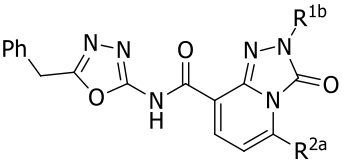
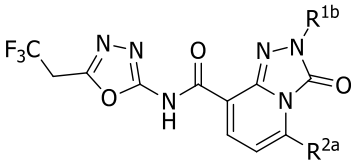
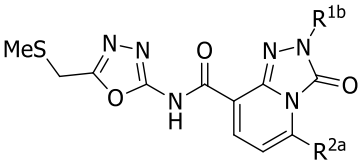
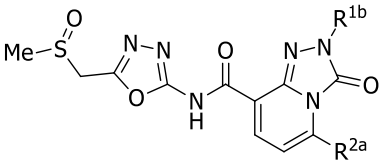
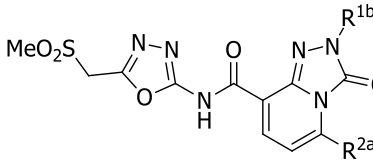
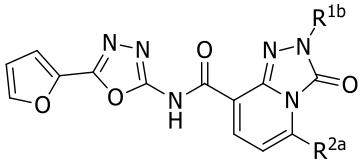
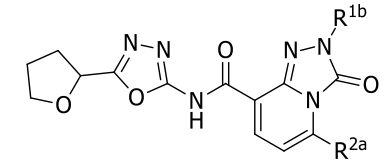
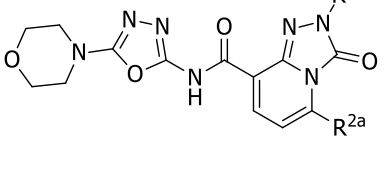
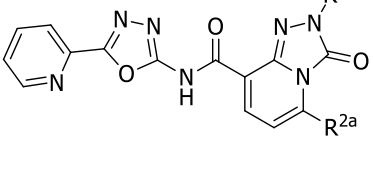
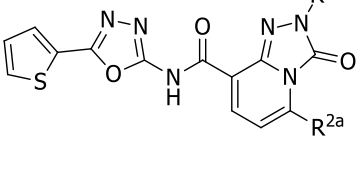
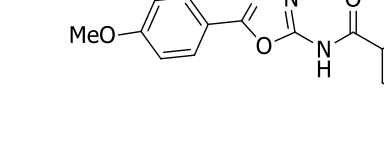
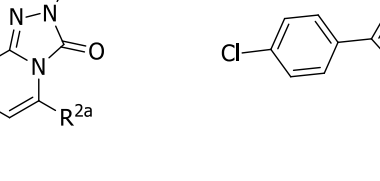
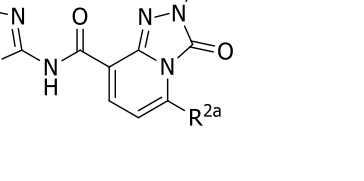
R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
N(Me)Me	N(Pr-n)Bu-n	N(Et)$(CH_2)_2$OEt
N(Me)Et	N(Pr-n)Bu-i	N(Et)$(CH_2)_2$OPr-n
N(Me)Pr-n	N(Pr-n)Bu-c	N(Et)$(CH_2)_2$OPr-i
N(Me)Pr-i	N(Pr-n)Bu-s	N(Pr-n)$(CH_2)_2$OMe
N(Me)Pr-c	N(Pr-i)Pr-i	N(Pr-n)$(CH_2)_2$OEt
N(Me)(D-16)	N(Pr-i)Pr-c	N(Pr-n)$(CH_2)_2$OPr-n
N(Me)(D-16e)	N(Pr-i)(D-16)	N(Pr-n)$(CH_2)_2$OPr-i
N(Me)Bu-n	N(Pr-i)(D-16e)	N(Pr-i)$(CH_2)_2$OMe
N(Me)Bu-i	N(Pr-i)Bu-n	N(Pr-i)$(CH_2)_2$OEt
N(Me)Bu-c	N(Pr-i)Bu-i	N(Pr-i)$(CH_2)_2$OPr-n
N(Me)Bu-s	N(Pr-i)Bu-c	N(Pr-i)$(CH_2)_2$OPr-i
N(Me)Bu-t	N(Pr-i)Bu-s	$NHCH_2SMe$
N(Me)Pen-n	$NHCH_2OMe$	$NHCH_2SEt$
N(Me)Pen-i	$NHCH_2OEt$	NHCH(Me)SMe
N(Me)Pen-c	NHCH(Me)OMe	NHCH(Me)SEt
N(Me)Pen-s	NHCH(Me)OEt	$NHC(Me)_2SMe$
N(Me)Pen-t	$NHC(Me)_2OMe$	$NHC(Me)_2SEt$
N(Me)(3-Pen)	$NHC(Me)_2OEt$	$NH(CH_2)_2SMe$
N(Me)Hex-n	$NH(CH_2)_2OMe$	$NH(CH_2)_2S(O)Me$
N(Me)Hex-c	$NH(CH_2)_2OEt$	$NH(CH_2)_2S(O)_2Me$
N(Et)Et	$NH(CH_2)_2OPr$-n	$NH(CH_2)_2SEt$
N(Et)Pr-n	$NH(CH_2)_2OPr$-i	$NH(CH_2)_2S(O)Et$
N(Et)Pr-i	$N(Me)CH_2OMe$	$NH(CH_2)_2S(O)_2Et$
N(Et)Pr-c	$N(Me)CH_2OEt$	$NH(CH_2)_2SPr$-i
N(Et)(D-16)	N(Me)CH(Me)OMe	$NH(CH_2)_2S(O)Pr$-i
N(Et)(D-16e)	N(Me)CH(Me)OEt	$NH(CH_2)_2S(O)_2Pr$-i
N(Et)Bu-n	$N(Me)C(Me)_2OMe$	$N(Me)CH_2SMe$
N(Et)Bu-i	$N(Me)C(Me)_2OEt$	$N(Me)CH_2SEt$
N(Et)Bu-c	$N(Me)(CH_2)_2OMe$	N(Me)CH(Me)SMe
N(Et)Bu-s	$N(Me)(CH_2)_2OEt$	N(Me)CH(Me)SEt
N(Pr-n)Pr-n	$N(Me)(CH_2)_2OPr$-n	$N(Me)C(Me)_2SMe$
N(Pr-n)Pr-i	$N(Me)(CH_2)_2OPr$-i	$N(Me)C(Me)_2SEt$
N(Pr-n)Pr-c	$N(Et)C(Me)_2OMe$	$N(Me)(CH_2)_2SMe$
N(Pr-n)(D-16)	$N(Et)C(Me)_2OEt$	$N(Me)(CH_2)_2S(O)Me$
N(Pr-n)(D-16e)	$N(Et)(CH_2)_2OMe$	$N(Me)(CH_2)_2S(O)_2Me$

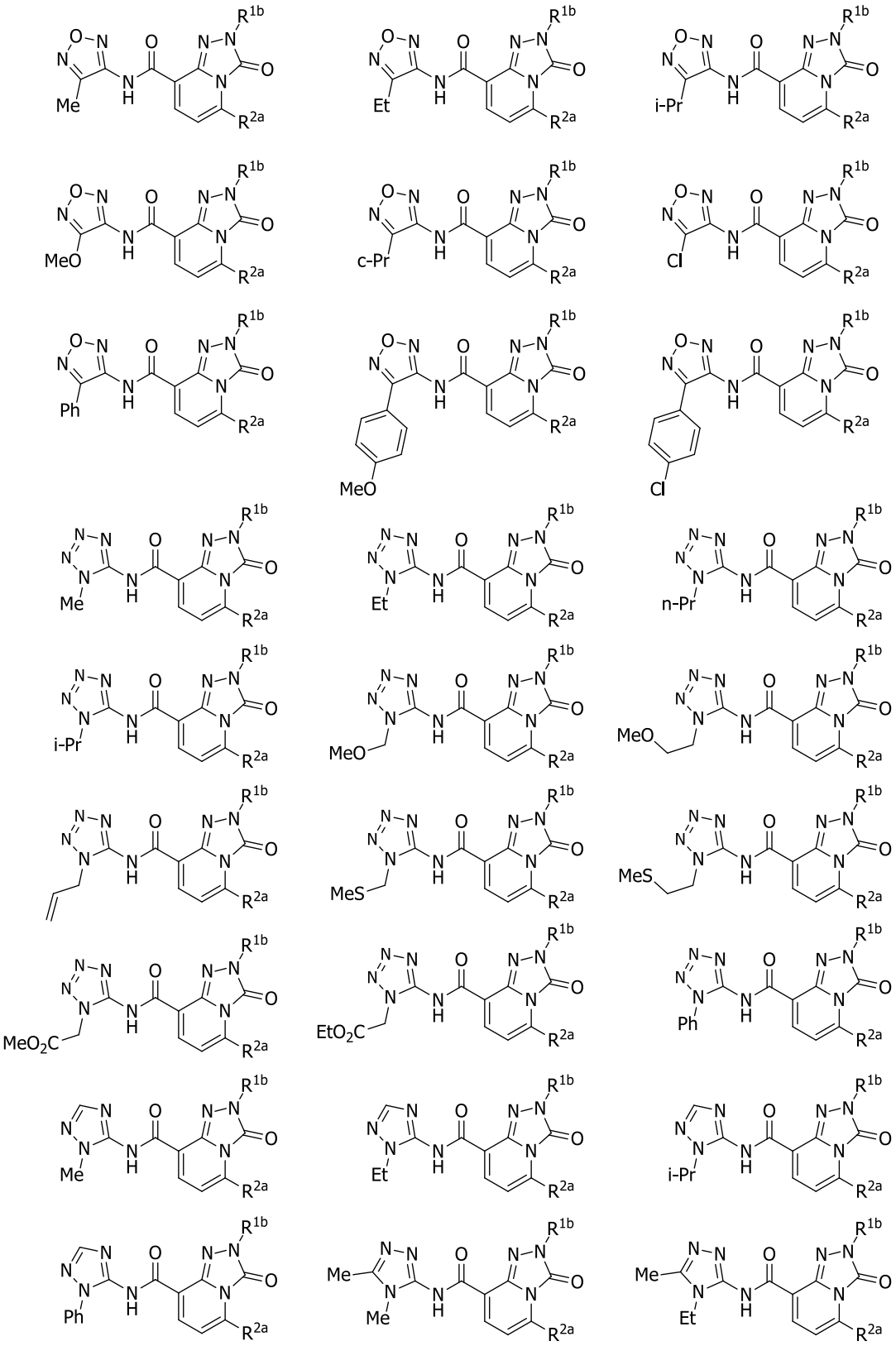
[Tabla 23]

R^{1a}
N(Me)$(CH_2)_2$SEt
N(Me)$(CH_2)_2$S(O)Et
N(Me)$(CH_2)_2$S$(O)_2$Et
N(Me)$(CH_2)_2$SPr-i
N(Me)$(CH_2)_2$S(O)Pr-i
N(Me)$(CH_2)_2$S$(O)_2$Pr-i
NHCF_2H
NHCF_3
NHCH_2CF_2H
NHCH_2CF_3
NH$(CH_2)_2CF_3$
NH$(CH_2)_2$Cl
NH$(CH_2)_3$Cl
N(Me)CF_2H
N(Me)CF_3
N(Me)CH_2CF_2H
N(Me)CH_2CF_3
N(Me)$(CH_2)_2CF_3$
N(Me)$(CH_2)_2$Cl
N(Me)$(CH_2)_3$Cl
NHCH_2CH=CH_2
N(Me)CH_2CH=CH_2
NHCH_2C≡CH
NHCH_2C≡CMe
N(Me)CH_2C≡CH
N(Me)CH_2C≡CMe
NHCH_2CN
NH$(CH_2)_2$CN
NH$(CH_2)_3$CN
N(Me)CH_2CN
N(Me)$(CH_2)_2$CN
N(Me)$(CH_2)_3$CN
NHPh
NH(2-MeO-Ph)
NH(3-MeO-Ph)

R^{1a}
NH(4-MeO-Ph)
NH(2,3-$(MeO)_2$-Ph)
NH(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
NH(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
NH(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
NH(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
NH(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)Ph
N(Me)(2-MeO-Ph)
N(Me)(3-MeO-Ph)
N(Me)(4-MeO-Ph)
N(Me)(2,3-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(3,5-$(MeO)_2$-Ph)

[0191] [Tercera Tabla]



[Tabla 24]

R^{2a}	R^{1b}
CF_2H	Me
CF_2H	Et
CF_2H	Pr-n
CF_2H	Pr-i
CF_2H	Pr-c
CF_2H	Bu-n
CF_2H	Bu-i
CF_2H	Bu-c
CF_2H	Bu-s
CF_2H	Bu-t
CF_2H	Pen-n
CF_2H	Pen-i
CF_2H	Pen-c
CF_2H	Pen-s
CF_2H	Pen-t
CF_2H	3-Pen
CF_2H	Hex-n
CF_2H	Hex-c
CF_2H	CH_2Ph
CF_2H	CH(Me)Ph
CF_2H	$(CH_2)_2Ph$
CF_2H	$(CH_2)_3Ph$
CF_2Cl	Me
CF_2Cl	Et
CF_2Cl	Pr-n
CF_2Cl	Pr-i
CF_2Cl	Pr-c
CF_2Cl	Bu-n
CF_2Cl	Bu-i
CF_2Cl	Bu-c
CF_2Cl	Bu-s
CF_2Cl	Bu-t
CF_2Cl	Pen-n
CF_2Cl	Pen-i

R^{2a}	R^{1b}
CF_2Cl	Pen-c
CF_2Cl	Pen-s
CF_2Cl	Pen-t
CF_2Cl	3-Pen
CF_2Cl	Hex-n
CF_2Cl	Hex-c
CF_2Cl	CH_2Ph
CF_2Cl	CH(Me)Ph
CF_2Cl	$(CH_2)_2Ph$
CF_2Cl	$(CH_2)_3Ph$
CF_2Br	Me
CF_2Br	Et
CF_2Br	Pr-n
CF_2Br	Pr-i
CF_2Br	Pr-c
CF_2Br	Bu-n
CF_2Br	Bu-i
CF_2Br	Bu-c
CF_2Br	Bu-s
CF_2Br	Bu-t
CF_2Br	CH_2Ph
CF_2Br	CH(Me)Ph
CF_3	Me
CF_3	Et
CF_3	Pr-n
CF_3	Pr-i
CF_3	Pr-c
CF_3	Bu-n
CF_3	Bu-i
CF_3	Bu-c
CF_3	Bu-s
CF_3	Bu-t
CF_3	Pen-n
CF_3	Pen-i

[Tabla 25]

R^{2a}	R^{1b}
CF_3	Pen-c
CF_3	Pen-s
CF_3	Pen-t
CF_3	3-Pen
CF_3	Hex-n
CF_3	Hex-c
CF_3	CH_2Ph
CF_3	CH(Me)Ph
CF_3	$(CH_2)_2Ph$
CF_3	$(CH_2)_3Ph$
CH_2CF_2H	Me
CH_2CF_2H	Et
CH_2CF_2H	Pr-n
CH_2CF_2H	Pr-i
CH_2CF_2H	Pr-c
CH_2CF_2H	Bu-n
CH_2CF_2H	Bu-i
CH_2CF_2H	Bu-c
CH_2CF_2H	Bu-s
CH_2CF_2H	Bu-t
CH_2CF_2H	CH_2Ph
CH_2CF_2H	CH(Me)Ph
CH_2CF_3	Me
CH_2CF_3	Et
CH_2CF_3	Pr-n
CH_2CF_3	Pr-i
CH_2CF_3	Pr-c
CH_2CF_3	Bu-n
CH_2CF_3	Bu-i
CH_2CF_3	Bu-c
CH_2CF_3	Bu-s
CH_2CF_3	Bu-t
CH_2CF_3	CH_2Ph
CH_2CF_3	CH(Me)Ph

R^{2a}	R^{1b}
$CHFCH_3$	Me
$CHFCH_3$	Et
$CHFCH_3$	Pr-n
$CHFCH_3$	Pr-i
$CHFCH_3$	Pr-c
$CHFCH_3$	Bu-n
$CHFCH_3$	Bu-i
$CHFCH_3$	Bu-c
$CHFCH_3$	Bu-s
$CHFCH_3$	Bu-t
$CHFCH_3$	CH_2Ph
$CHFCH_3$	CH(Me)Ph
CF_2CH_3	Me
CF_2CH_3	Et
CF_2CH_3	Pr-n
CF_2CH_3	Pr-i
CF_2CH_3	Pr-c
CF_2CH_3	Bu-n
CF_2CH_3	Bu-i
CF_2CH_3	Bu-c
CF_2CH_3	Bu-s
CF_2CH_3	Bu-t
CF_2CH_3	CH_2Ph
CF_2CH_3	CH(Me)Ph
$CF(CH_3)_2$	Me
$CF(CH_3)_2$	Et
$CF(CH_3)_2$	Pr-n
$CF(CH_3)_2$	Pr-i
$CF(CH_3)_2$	Pr-c
$CF(CH_3)_2$	Bu-n
$CF(CH_3)_2$	Bu-i
$CF(CH_3)_2$	Bu-c
$CF(CH_3)_2$	Bu-s
$CF(CH_3)_2$	Bu-t

[Tabla 26]

COMPUESTO HETEROCÍCLICO DE AMIDA

CAMPO TÉCNICO

[0001] La presente invención se relaciona con un nuevo compuesto heterocíclico de amida y su sal, y productos químicos agrícolas, en particular herbicidas, que contienen el compuesto de amida heterocíclica o su sal como ingrediente activo. El producto químico agrícola en la presente invención significa un insecticida/acaricida, un nematicida, un herbicida, un bactericida y similares dentro de los campos agrícola y hortícolas.

ANTECEDENTES

[0002] Por ejemplo, cierto tipo de compuestos heterocíclicos de amida han sido dados a conocer en Documentos de Patentes del 1 al 6. Sin embargo el compuesto heterocíclico de amida no ha sido dado a conocer en absoluto.

Documentos del estado de la técnica

Patentes

[0003] Documento 1: Publicación Internacional No. 2012/028579 (WO 2012/028579)

Documento 2: Publicación Internacional No. 2012/123409 (WO 2012/123409)

Documento 3: Publicación Internacional No. 2012/123416 (WO 2012/123416)

Documento 4: Publicación Internacional No. 2012/126932 (WO 2012/126932)

Documento 5: Publicación Internacional No. 2013/017559 (WO 2013/017559)

Documento 6: Publicación Internacional No. 2013/064457 (WO 2013/064457)

RESUMEN

Problema a Resolver

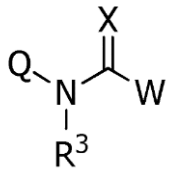
[0004] El objeto de la presente invención es proveer una sustancia química que efectivamente produzca efectos sobre varias malezas con la aplicación de pequeñas cantidades del químico, con una reducida contaminación del suelo e influencia sobre las cosechas subsiguientes, con un alto nivel de seguridad, y que sea útil como componente activo de herbicidas.

Medios para resolver el Problema

[0005] Como resultado de una exhaustiva investigación para resolver el problema, los inventores de la presente invención encontraron que un nuevo compuesto heterocíclico de amidade formula (1) de acuerdo a la presente invención tiene una excelente actividad herbicida como herbicida y un alto nivel de seguridad dirigido a cultivos sin mostrar efectos adversos sobre creaturas tales como mamíferos, peces, e insectos benéficos, y que es un compuesto muy útil , y así sus inventores han realizado la presente invención.

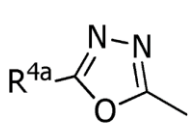
[0006] Más específicamente, la presente invención se relaciona con los siguientes [1] a [115] asuntos.

[1] Un compuesto de amida heterocíclica de formula (1):

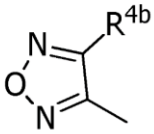


(1)

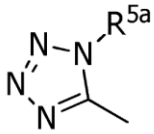
Donde Q es un heterociclo aromático de cada uno de Q1 a Q5.



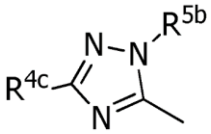
Q-1



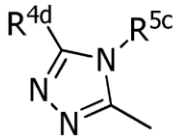
Q-2



Q-3

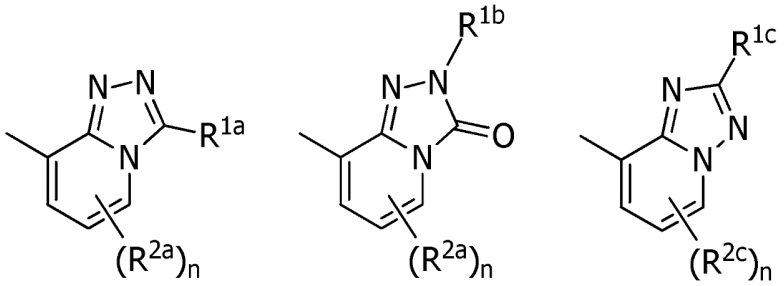


Q-4



Q-5

W es un heterociclo aromático de W-1, W-2 o W-3;



W-1 W-2 W-3

X es un átomo de oxígeno o de azufre;

R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquilo C_{3-6}, (cicloalquilo C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6, alquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6}, - C (O) R^8, -C (O) OR^{16}, ciano, -OR^9, -$S(O)_{m1}R^{10}$, -N (R^{11}) R^{12}, -C (= NR^{12b}) R^{8b}, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, naftilo, o cualquier grupo de U-1 a U-25;

R^{1b} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquiloC_{3-6}, (cicloalquiloC_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6, alqueniloC_{2-6}, C_{2-6} alquinilo, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, naftilo, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6-miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

R^{1c} es alquiloC1-6;

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, haloalquiloC_{1-6}, - C (O) R^{18}, -C (O) OR^{24}, ciano, nitro, -OR^{19},-$S(O)_{m3}R^{20}$, -N (R^{21})^{22}, fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$; siendo n un entero de 2 o más, R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes unos de otros, y cuando dos R^{2a} están adyacentes, las dos adyacentes R^{2a} forman opcionalmente un anillo de 6 miembros con átomos de carbono unidos a cada R^{2a} formando -CH = CH-CH = CH-;

$R^{2\,c}$ es haloalquiloC_{1-6};

R^3 es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquiloC_{3-6}, alqueniloC_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, -C (O) R^{25} o -C (O) OR^{26};

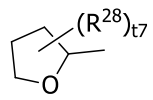
R^{4a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquiloC_{3-6}, (cicloalquilo C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^{27}, alquenilo C_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, haloalquiniloC_{2-6}, cicloalqueniloC_{3-6}, -NH_2,

alquilaminaC_{1-6}, di(alquiloC1-6)amina, - NHC (O) R^8, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

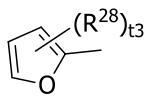
R^{4b} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, ciano, nitro, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^{27}, alqueniloC$_{2-6}$, haloalqueniloC$_{2-6}$, alquiniloC$_{2-6}$, haloalquiniloC$_{2-6}$, cicloalqueniloC$_{3-6}$, - C (O) OR^{16}, -OR^{38},-S(O)$_{m3}R^{20}$, -NH_2, alquilaminaC$_{1-6}$, di(alquilC$_{1-6}$) amina, - NHC (O) R^8, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

R^{4c} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquiloC$_{3-6}$, (cicloalquiloC$_{3-6}$) opcionalmente sustituido con R^{27}, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

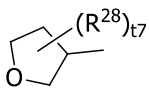
R^{4d} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{35}; U-1 a U-6, U-6a, U-7 a U-10, U-10, U-11, U-11, U-12, U-12a, U-13, U-13, U-14 U-22, U-22a, U-23, U-24, U-25 y U-26 son respectivamente heterociclos de las siguientes estructuras:



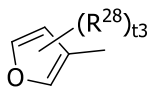
U-1



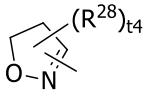
U-2



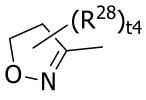
U-3



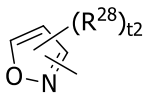
U-4



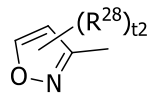
U-5



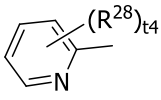
U-5a



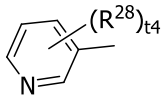
U-6



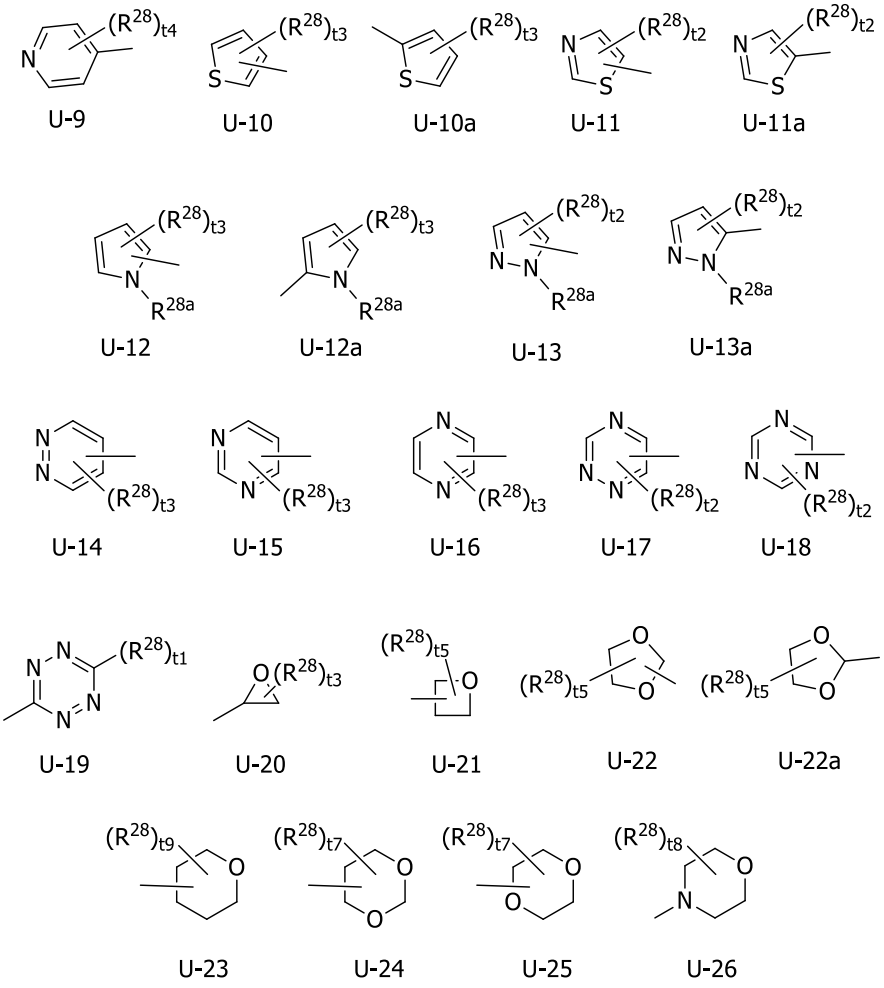
U-6a



U-7



U-8



R^{5a} yR^{5b} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquiloC_{3-6}, halocicloalquiloC_{3-6}, alqueniloC_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, haloalquiniloC_{2-6}, cicloalqueniloC_{3-6}, fenilo o fenilo sustituido con $(R^{28})_r$;

R^{5c} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{36} o R^{5c} opcionalmente forma un anillo de 6 miembros con un nitrógeno átomo al que R^{5c} está unido y un átomo de carbono al que R^{4d} se enlaza para formar -$(CH_2)_4$- o -CH = CH-CH = CH- con R^{4d};

R^6 es un átomo de halógeno, ciano, nitro, cicloalquilo C_{3-6}, - C (O) R^8, -C (O) OR^{16}, -OR^{13}, -S(O) $_{m2}$ R^{14}, fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$;

R^7 es un átomo de halógeno, ciano, nitro, alquiloC1-6, alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquiloC_{3-6}, halocicloalquiloC_{3-6}, alqueniloC_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, haloalquiniloC_{2-6}, cicloalqueniloC_{3-6}, alquiniloC_{1-6}, cicloalquilcarboniloC_{3-6},

haloalquilcarbonilo C_{1-6}, halocicloalquilcarbonilo C_{3-6}, alcoxicarbonilo C_{1-6}, haloalcoxicarbonilo C_{1-6}, alquilaminocarbonilo C_{1-6}, haloalquilaminocaronilo C_{1-6}, di(alquilamino C_{1-6}) carbonilo, -OR^{15}, -$S(O)_{m3}R^{20}$, alquilaminosulfonilo C_{1-6}, di(alquilC_{1-6}) aminosulfonilo, -NH_2, alquilaminaC_{1-6}, di(alquiloC1-6)amina, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

R^8 es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o -N R (R^{11a}) R^{12a}

R^{8b} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^9 es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o fenilo;

R^{10} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6} o haloalquinilo C_{2-6};

R^{11} y R^{12} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6} o haloalquinilo C_{2-6}; fenilosulfonilo, fenilo, fenilo sustituido $(R^7)_p$, U-7, U-8, U-9 y U-14 y U-19 o R^{11} opcionalmente forma un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al cual R^{11} y R^{12} se adhieren formando un alquileno C_{2-6} de cadena junto con R^{12}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene un O, S, S(O), $S(O)_2$, o N (R^{33}) y es opcionalmente sustituido con un grupo oxo o un grupo tioxo;

R^{12b} es -OR^{19b};

R^{13} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, - C (O) R^8 o fenilo;

R^{14} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, o fenilo;

R^{15} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6} o cicloalquenilo C_{3-6};

R^{16} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{37};

R^{18} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{19} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o fenilo;

R^{19b} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{20} es alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6} , haloalquinilo C_{2-6} o cicloalquenilo C_{3-6};

R^{21} y R^{22} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, o fenilo, o R^{21} opcionalmente forma un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al cual R^{21} y R^{22} están unidos formando una cadena de alquileno de 2-6 carbones con R^{22}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene un O , S, S(O), $S(O)_2$, o N (R^{39}) y está opcionalmente sustituido con un grupo oxo o un grupo de tioxo;

R^{24} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{25} y R^{26} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6} , cicloalquenilo C_{3-6} o fenilo;

R^{27} es un átomo de halógeno, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, -C (O) OR^{16}, -OR^{29}, -$S(O)_{m4}R^{30}$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

R^{28} es un halógeno átomo, ciano, nitro, alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, (alcoxilo C_{1-6}) alquiloC1-6, -OR^{31} o $S(O)_{m4}R^{30}$; cuando t2, t3, t4, t5, t7, t8 o t9 es un entero de 2 o más, R^{28} opcionalmente son iguales o diferentes entre sí; más cuando dos R^{28} son adyacentes, las dos adyacentes R^{28} opcionalmente forman un anillo de 6 miembros con átomos de carbono al cual cada R^{28} se une formando -CH = CH-CH = CH-;

R^{28a} es alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, (alcoxilo C_{1-6}) alquiloC1-6 o (alquiltio C_{1-6}) alquiloC1-6

R^{29}, R^{30} y R^{31} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquiniloC$_{2-6}$, haloalquinilo C_{2-6}, cicloalqueniloC_{3-6} o fenilo;

R^{33} es un átomo de hidrógeno o AlquiloC1-6;

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C_{3-6}, - C (O) R^8, -C (O) OR^{16}, -OR^{33}, -$S(O)_{m6}R^{33}$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-1 U-3, U-7, U-8, U-9 y U-14 a U-25;

R^{35} es un átomo de halógeno o alcoxilo C_{1-6};

R^{36} es un átomo de halógeno o alcoxilo C_{1-6};

R^{37} es alcoxilo C_{1-6};

R^{38} es alquiloC1-6, alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquiloC_{3-6}, halocicloalquiloC_{3-6}, alqueniloC_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, haloalquiniloC_{2-6}, cicloalqueniloC_{3-6} o fenilo;

R^{39} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

t1 es un entero de 0 o 1;

m1, m2, m3, m4, m6 y el t2 son cada uno independientemente un número entero de 0, 1 o 2;

n y t3 son cada uno independientemente un número entero de 0, 1, 2 o 3;

p y r son cada uno independientemente un número entero de 1, 2, 3, 4 o 5;

[0007] [2]

La amida heterocíclica compuesta o la sal misma según [1], en la que W es un heterociclo aromático de 1 W o W-2; y

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, haloalquiloC_{1-6}, - C (O) R^{18}, -C (O) OR^{24}, ciano, nitro, -o^{19}, o-S(O) $_{m3}$ R^{20}, y cuando n es un entero de 2 o más, R^{2a} opcionalmente igual o diferentes unos de otros.

[0008] [3]

El compuesto amida heterocíclico, o la sal del mismo según [2], en la cual R^{1b} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquilo C_{3-6}, (C_{3-6} cicloalquilo) opcionalmente sustituido con R^6, alquenilo C_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, naftilo o cualquier grupo de U-1 a U-25;

R^{4a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^{27}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6}, - NH_2, alquilamina C_{1-6}, di(alquil $_{1-6}$) amina, - NHC (O) R^8, fenilo , fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, o cualquier grupo de U-1 a U-26;

R^7 es un átomo de halógeno, ciano, nitro, alquiloC1-6, alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6}, alquenilcarbonilo C_{1-6}, cicloalquilcarbonilo C_{3-6}, haloalquilcarbonilo C_{1-6}, halocicloalquilcarbonilo C_{3-6}, alcoxilcarbonilo C_{1-6},

haloalcoxilcarbonilo C_{1-6}, alquilaminocarbonilo C_{1-6}, haloalquilaminocarbonilo C_{1-6}, di(alquilaminoC_{1-6}) carbonilo, -OR^{15}, -$S(O)_{m3}R^{20}$, alquilaminosulfonilo C_{1-6}, di(alquiloC1-6) aminosulfonilo, -NH_2, alquilamina C_{1-6}, di(alquiloC1-6) amina, o cualquier grupo de U-1 a U-26; y

R^{27} es un átomo de halógeno, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido $(R^{28})_r$, -C (O) OR^{16}, -OR^{29},-$S(O)_{m4}R^{30}$ o cualquier grupo de U-1 a U-26.

[0009] [4]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal del mismo según [3], en la cual R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquilo C_{3-6}, (cicloalquilo C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6, alquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6}, - C (O) R^8, -OR^9, -$S(O)_{m1}R^{10}$, -N (R^{11}) R^{12}, -C (= N^{12b}) R^{8b}, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-3, U-5a, U-6a, U-7, U-8, U-10a, U-11a, U-12a o U-13a;

R^{1b} es alquiloC1-6 o (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6} o -$S(O)_{m3}R^{20}$, y cuando n es un entero de 2 o más, los R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí;

R^3 es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{4a} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$ o un heterociclo de U-1, U 2, U-7, U-10 y U-26;

R^{4b} es alquiloC1-6;

R^{4c} es un átomo de hidrógeno;

R^{d4} es alquiloC1-6;

R^{5a} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R_{27}, alquenilo C_{2-6} o fenilo;

R^{5b} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{5c} es alquiloC1-6, o R^{5c} opcionalmente forma un anillo de 6 miembros con un átomo de nitrógeno al que R^{5c} está unido y un átomo de carbono al que R^{4d} se enlaza mediante la formación de -$(CH_2)_4$- o -CH = CH-CH = CH-R^{4d};

R^7 es un átomo de halógeno, alquiloC1-6; (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, o -OR^{15};

R^{8b} es un átomo de hidrógeno;

R^9 es alquiloC1-6;

R^{10} es alquiloC1-6; (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6} o alquinilo C_{2-6};

R^{11} es alquiloC1-6; (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6} o alquinilo C_{2-6}, fenilosulfonilo, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$ o U-7;

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{11} opcionalmente forma un anillo de 5-6-miembros junto con un átomo de nitrógeno al cual R^{11} y R^{12} están unidos formando una cadena de alquilenoC$_{4-5}$ junto con R^{12}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene un O, S, S(O) o $S(O)_2$;

R^{11a} es alquiloC1-6;

R^{12a} es un átomo de hidrógeno;

R^{13} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, - C (O) R^8 o fenilo;

R^{14} es alquiloC1-6 o (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{15} es alquiloC1-6;

R^{19b} es alquiloC1-6;

R^{20} es alquiloC1-6;

R^{27} es un átomo de halógeno, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, -OR^{29}, -C (O) OR^{16}, o -$(O)_{m4}$ R^{28} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, o -OR^{31}; cuando t2, t3, t4, t5 y t7 son enteros de 2 o más, las R^{28} opcionalmente son iguales o diferentes entre sí; y más cuando dos R^{28} son adyacentes, las dos adyacentes R^{28} opcionalmente forman un anillo de 6 miembros con átomos de carbono para que cada R^{28} se una formando -CH = CH-CH = CH-;

R^{29} es alquiloC1-6;

R^{30} es alquiloC1-6;

R^{31} es alquiloC1-6;

R^{33} es alquiloC1-6; y

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquiloC$_{3-6}$, - C (O) R^8, -C (O) OR^{16}, -OR^{33},-$S(O)_{m6}R^{33}$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-1, U-8 o U-22a.

[0010] [5]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según [4], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-1; y

W es un heterociclo aromático de W-1.

[0011] [6]

La amida heterocíclica compuesta o la sal de la misma según [5], donde X es un átomo de oxígeno;

R^{1a} un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquilo C_{3-6}, (cicloalquilo C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6, alquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6}, - C (O) R^8, -OR^9, -$S(O)_{m1}R^{10}$, -N (R^{11}) R^{12}, - C (= N^{12b}) R^{8b}, fenilo , fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-5a, U-6a, U-7, U-8, U-10a, U-11a, U-12a o U-13a;

R^{2a} es alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6} o-$S(O)_{m3}R^{20}$, y cuando n es un entero de 2 o más, R^{2a} opcionalmente son iguales o diferentes entre sí;

R^6 es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C_{3-6}, -C (O) R^8, -C (O) OR^{16}, -OR^{13},-$S(O)_{m2}R^{14}$ o fenilo sustituido con $(R^7)_p$; y

R^{27} es un halógeno átomo, fenilo, -$OR^{29,}$ o -$S(O)_{m4}R^{30}$.

[0012] [7]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según [6], en la cual R^{4a} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27} o cicloalquiloC_{3-6}; y

R^{27} es un átomo de halógeno o -OR^{29}.

[0013] [8]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según [4], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-3; y

W es un heterociclo aromático de W-1.

[0014] [9]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según [8], en la cual R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquiloC_{3-6}, cicloalquilo(C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6, alqueniloC_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, - C (O) R^8,-$S(O)_{m1}R^{10}$, -N (R^{11}) R^{12} , fenilo, fenilo sustituido $(R^7)_p$, U-3, U-5a, U-6a, U-8, U-10a o U-13a;

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6 o haloalquilo C_{1-6}, y cuando n es un entero de 2 o más, R^{2a} are opcionalmente iguales o diferentes entre sí;

R^6 es un átomo de halógeno, - C (O) OR^{16}, -OR^{13},-$S(O)_{m2}R^{14}$ o fenilo sustituido con $(R^7)_p$;

R^7 es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, o -OR^{15};

R^8 es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{11} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$;

R^{11} opcionalmente forma un anillo de 6 miembros con un átomo de nitrógeno al cual R^{11} y R^{12} están unidos formando una cadena de alquileno C_5 junto con R^{12}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene un O, S, S(O) o $S(O)_2$;

R^{16} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{27} es fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, -OR^{29}, -C (O) OR^{16} o -$S(O)_{m4}R^{30}$;

R^{28} es un átomo de halógeno o alquiloC1-6; y

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano, C_{3-6} cicloalquilo, -OR^{33}, -$S(O)_{m6}R^{33}$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-1 y U-8.

[0015] [10]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según [9], en la cual R^{5a} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27} o alquenilo C_{2-6}; y

R^{27} es -OR^{29} o -$S(O)_{m4}R^{30}$.

[0016] [11]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [10], donde X es un átomo de oxígeno.

[0017] de [12]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [10], donde X es un átomo de azufre.

[0018] [13]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [12], en que R^3 es un átomo de hidrógeno.

[0019] [14]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [12], en que R^3 es alquiloC1-6.

[0020] [15]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [14], en que R^{2a} es haloalquilo C_{1-6}.

[0021] [16]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [14], en que R^{2a} es un átomo de halógeno.

[0022] [17]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [14], en que R^{2a} es $-S(O)_{m3}R^{20}$; y

R^{20} es alquiloC1-6.

[0023] [18]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [14], en que R^{2a} es trifluorometilo.

[0024] [19]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [18], en que n es un entero de 1, 2 o 3.

[0025] [20]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] [18], en que n es un entero de 1.

[0026] [21]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-2; y

W es un heterociclo aromático de W-1.

[0027] [22]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-4; y

W es un heterociclo aromático de W-1.

[0028] [23]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-5; y

W es un heterociclo aromático de W-1.

[0029] [24]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-1; y

W es un heterociclo aromático de W-2.

[0030] [25]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-2; y

W es un heterociclo aromático de W-2.

[0031] [26]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-3; y

W es un heterociclo aromático de W-2.

[0032] [27]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-4; y

W es un heterociclo aromático de W-2.

[0033] [28]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-5; y

W es un heterociclo aromático de W-2.

[0034] [29]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-1; y

W es un heterociclo aromático de W-3.

[0035] [30]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-2; y

W es un heterociclo aromático de W-3.

[0036] [31]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-3; y

W es un heterociclo aromático de W-3.

[0037] [32]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-4; y

W es un heterociclo aromático de W-3.

[0038] [33]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-5; y

W es un heterociclo aromático de W-3.

[0039] [34]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [33], en que R^{4a} es un átomo de hidrógeno.

[0040] [35]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [33], en que R^{4a} es un átomo de hidrógeno o AlquiloC1-6.

[0041] [36]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [33], en que R^{4a} es AlquiloC1-6.

[0042] [37]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] [33], en que R^{4a} es C_{1-3} alquilo.

[0043] [38]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [33], en que R^{4a} es metilo.

[0044] [39]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [33], en que R^{4a} es etilo.

[0045] [40]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [33], en que R^{4a} es cicloalquilo C_{3-6}.

[0046] [41]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [33], en que R^{4a} es haloalquilo C_{1-3}.

[0047] [42]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [41], en que R^{5a} es un átomo de hidrógeno.

[0048] [43]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [41], en que R^{5a} es alquiloC1-6.

[0049] [44]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [41], en que R^{5a} es alquiloC_{1-3}.

[0050] [45]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [41], en que R^{5a} es metilo.

[0051] [46]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [41], en que R^{5a} es etilo.

[0052] [47]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [41], en la cual R^{5a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27};

R^{27} es $-OR^{29}$ o $-S(O)_{m4}R^{30}$;

R^{29} es alquiloC1-6; y

R^{30} es alquiloC1-6.

[0053] [48]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [41], en que R^{5a} es alquenilo C_{2-6}.

[0054] [49]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6, alquenilo C_{2-6}, - CHO,$-S(O)_{m1}R^{10}$, $-N(R^{11})R^{12}$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-3, U-5a, U-6a, U-7, U-8, U-10a, U-11a, U-12a o U-13a;

R^6 es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C_{3-6}, $-C(O)OR^{16}$, $-OR^{13}$,$-S(O)_{m2}R^{14}$, fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$;

R^8 es alquiloC1-6;

R^{10} alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquiloC_{3-6} o alqueniloC$_{2-6}$;

R^{11} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquiloC_{3-6}, alqueniloC$_{2-6}$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$ o U-7;

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{11} opcionalmente forma un anillo de 5-6 miembros junto con un átomo de nitrógeno al cual R^{11} y R^{12} están unidos formando una cadena de alquileno C_{4-5} junto con R^{12}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene un O, S, S(O) o $S(O)_2$;

R^{13} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{14} alquiloC1-6 o (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{16} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{37}; y

R^{34} es ciano, cicloalquilo C_{3-6}, - C (O) R^8, -C (O) OR^{16}, -OR^{33}, -$S(O)_{m6}$ R^{33}o U-1.

[0055] [50]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es alquiloC1-6, cicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6} o - CHO.

[0056] [51]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es alquiloC1-6 o cicloalquilo C_{3-6}.

[0057] [52]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es alquiloC1-6.

[0058] [53]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es cicloalquilo C_{3-6}.

[0059] [54]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6; y

R^6 es un átomo de halógeno.

[0060] [55]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6; y

R^6 es ciano.

[0061] [56]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6; y

R^6 es cicloalquilo C_{3-6}.

[0062] [57]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6; y

R^6 es - C (O) OR^{16}.

[0063] [58]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es -OR^{13}; y

R^{13} es alquiloC1-6.

[0064] [59]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es -OR^{13};

R^{13} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{34} es -OR^{33}; y

R^{33} es alquiloC1-6.

[0065] [60]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es-$S(O)_{m2}$ R^{14};

R^{14} alquiloC1-6 o alquil (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{34} es un átomo de halógeno o -OR^{33}; y

R^{33} es alquiloC1-6.

[0066] [61]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es $-S(O)_{m2}R^{14}$;

R^8 es alquiloC1-6;

R^{14} (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{16} es alquiloC1-6;

R^{34} es ciano, cicloalquilo C_{3-6}, $-C(O)R^8$, $-C(O)OR^{16}$, $-OR^{33}$o $-S(O)_{m6}R^{33}$; y

R^{33} es alquiloC1-6.

[0067] [62]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es $-S(O)_{m2}R^{14}$; y

R^{14} es alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6} o haloalquinilo C_{2-6}.

[0068] [63]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6; y

R^6 es un átomo de halógeno.

[0069] [64]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es $-OR^{13}$; y

R^{13} es alquiloC1-6.

[0070] [65]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-$S(O)_{m1}R^{10}$.

[0071] [66]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-$S(O)_{m1}R^{10}$;

R^{10} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6} o alquenilo C_{2-6};

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquiloC_{3-6}, - C (O) R^{8}, -C (O) OR^{16}, o -OR^{33};

R^{8} es alquiloC1-6;

R^{16} es alquiloC1-6; y

R^{33} es alquiloC1-6.

[0072] [67]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-$S(O)_{m1}R^{10}$; y

R^{10} es alquiloC1-6.

[0073] [68]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-$S(O)_{m1}R^{10}$; y

R^{10} es cicloalquilo C_{3-6}.

[0074] [69]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-$S(O)_{m1}R^{10}$; y

R^{10} es alquenilo C_{2-6}.

[0075] [70]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-$S(O)_{m1}R^{10}$; y

R^{10} es alquinilo C_{2-6}.

[0076] [71]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-$S(O)_{m1}R^{10}$;

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es un átomo de halógeno.

[0077] [72]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-$S(O)_{m1}R^{10}$;

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con $R^{34;}$ y

R^{34} es ciano.

[0078] [73]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-$S(O)_{m1}R^{10}$;

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con $R^{34;}$ y

R^{34} es cicloalquilo C_{3-6}.

[0079] [74]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-$S(O)_{m1}R^{10}$;

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{34} es -C(O) R^{8} -C(O) OR^{16};

R^{8} es alquiloC1-6; y

R^{16} es alquiloC1-6.

[0080] [75]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-$S(O)_{m1}R^{10}$;

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{34} es -OR^{33}; y

R^{33} es alquiloC1-6.

[0081] [76]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-$S(O)_{m1}R^{10}$

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{34} es -$S(O)_{m6}R^{33}$; y

R^{33} es alquiloC1-6.

[0082] [77]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R_{1a} es -N (R^{11}) R^{12}.

[0083] [78]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12};

R^{11} es alquiloC1-6;

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6.

[0084] [79]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12};

R^{11} es (AlquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6} o alquenilo C_{2-6} ;

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano o-S(O) $_{m6}$ R^{33}; y

R^{33} es alquiloC1-6.

[0085] [80]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12};

R^{11} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{34} es -OR^{33}; y

R^{33} es alquiloC1-6.

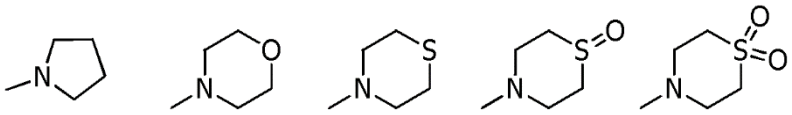
[0086] [81]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12}; y

R^{11} opcionalmente forma un anillo de 5-6 miembros junto con un átomo de nitrógeno al cual R^{11} y R^{12} están unidos formando una cadena de C_{4-5} alquileno junto con R^{12}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene un O, S, S(O) o $S(O)_2$.

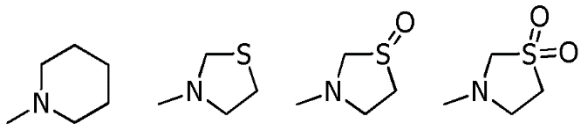
[0087] [82]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es un sustituto de las siguientes fórmulas de estructura:



[0088] [83]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es un sustituto de las siguientes fórmulas de estructura:



[0089] [84]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$.

[0090] [85]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6; y

R^6 es fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$.

[0091] [86]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es -OR^{13};

R^{13} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$.

[0092] [87]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es $–S(O)_{m2}R^{14}$;

R^{14} (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$.

[0093] [88]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es $–S(O)_{m1}R^{10}$;

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

[0093] [88]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es $–S(O)_{m1}R^{10}$;

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$.

[0094] [89]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12};

R^{11} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{34} es fenilo o fenilo sustituido con (R^7) $_p$.

[0095] [90]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12};

R^{11} es fenilo o fenilo sustituido con (R^7) $_p$; y

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6.

[0096] [91]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [84] al [90], en que R^7 es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27} o -OR^{15};

R^{15} es alquiloC1-6;

R^{27} es un átomo de halógeno, -OR^{29} o -S(O) $_{m4}$ R^{30}; y

R^{29} y R^{30} son cada uno independientemente alquiloC1-6.

[0097] [92]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [84] al [90], en que R^7 es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, o -OR^{15};

R^{15} es alquiloC1-6; y

R^{27} es un átomo de halógeno.

[0098] [93]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es de heterociclos de U-1 a U-25.

[0099] [94]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es U 3, U-5a, U-6a, U-7, U-8, U-10a, U-11a, U-12a o U-13a.

[0100] [95]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12}; y

R^{11} es U-7, U-8, U-9 o U-14 a U-19; y

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6.

[0101] [96]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12};

R^{11} es U-7; y

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6.

[0102] [97]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -S(O) $_{m1}$ R^{10};

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es U-7, U-8, U-9 o U-14 a U-19.

[0103] [98]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -S(O) $_{m1}$ R^{10};

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es U 1, U-3 o U-20 a U-25.

[0104] [99]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -S(O) $_{m1}$ R^{10};

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es U-1, U-3 o U-22a.

[0105] [100]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12};

R^{11} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6; y

R^{34} es U-7, U-8, U-9 y U-14 a U-19.

[0106] [101]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12};

R^{11} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6; y

R^{34} es U 1, U-3 y U-20 a U-25.

[0107] [102]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12};

R^{11} es alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6; y

R^{34} es U-1, U-3 o U-22a.

[0108] [103]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{6};

R^{6} es -OR^{13};

R^{13} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es U-7, U-8, U-9 y U-14 a U-19.

[0109] [104]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{6};

R^{6} es -OR^{13};

R^{13} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es U 1, U-3 o U-20 a U-25.

[0110] [105]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{6};

R^{6} es -OR^{13};

R^{13} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es U-1, U-3 o U-22a.

[0111] [106]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{6};

R^{6} es –$S(O)_{m2}R^{14}$;

R^{14} (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es U-7, U-8, U-9 o U-14 a U-19.

[0112] [107]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{6};

R^{6} es $–S(O)_{m2}R^{14}$;

R^{14} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es U-1, U-3 o U-20 a U-25.

[0113] [108]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{6};

R^{6} es $–S(O)_{m2}R^{14}$;

R^{14} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es U-1, 3 U o U-22a.

[0114] [109]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [93] a [108], en el que t1, t2, t3, t4, t5, t7, t8 y t9 son cada uno independientemente un número entero de 0.

[0115] [110]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [93] a [108], en que R^{28} es un átomo de halógeno, ciano, alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, (C_{1-6} alcoxilo) alquiloC1-6, $-o^{31}o-S(O)_{m4}R^{30}$.

[0116] [111]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [93] a [108], en que R^{28} es un átomo de halógeno.

[0117] [112]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [93] a [108], en que R^{28} es alquiloC1-6.

[0118] [113]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [93] a [108], en que R^{28} es alcoxiloC_{1-6}.

[0119] [114]

Un químico agrícola que comprende uno, dos o más compuestos de amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [113] como un componente activo.

[0120] [115]

Un herbicida que comprende uno, dos o más compuestos de amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [113] como un componente activo.

Efectos de la invención

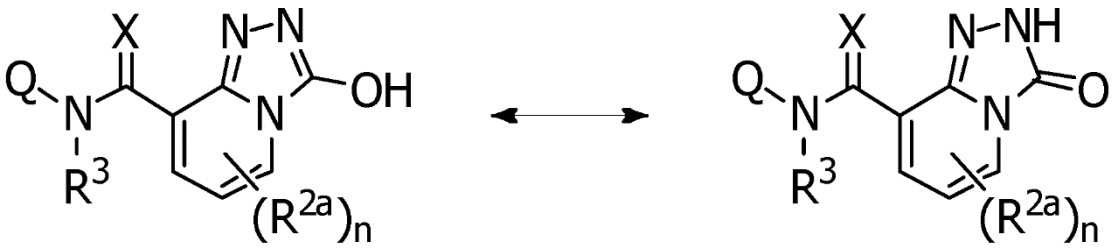
[0121] Los compuestos de la presente invención poseen excelente actividad herbicida para varias malas hierbas y un alto nivel de seguridad a los cultivos objetivo. Además, los compuestos de la presente invención no tienen casi ningún efecto adverso sobre distintos criaturas tales como mamíferos, peces e insectos beneficiosos y tienen liviana carga ambiental debido a las bajas propiedades residuales.

Por consiguiente, la presente invención puede proporcionar un herbicida útil en los campos agrícolas y hortícolas tales como campos de arroz, campos secos y huertos.

MODOS PARA REALIZAR EL INVENTO

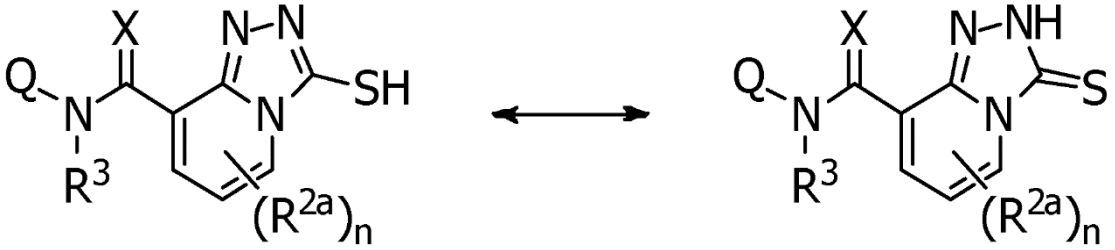
Los compuestos incluidos en la presente invención pueden incluir los isómeros geométricos de una forma E y una forma Z dependiendo de los sustituyentes. La presente invención incluye la forma-E, la forma de Z, y una mezcla de los E-forma y la forma de Z en cualquier proporción. Los compuestos incluidos en la presente invención incluyen isómeros ópticamente activos debido a la existencia de uno o dos o más de los átomos de carbono asimétricos. La presente invención incluye todos los isómeros ópticamente activos o formas racémicas.

Los compuestos incluidos en la presente invención pueden incluir tautómeros dependiendo de los sustituyentes. La presente invención incluye todos los tautómeros o una mezcla de los tautómeros incluidos en cualquier proporción. Por ejemplo, en el caso del compuesto de la Fórmula (1): [donde W es W-1; R^{1a} es un grupo hidroxi; n, Q, $R^{2a,}$ $R^{3,}$ y X significa lo mismo que se ha descrito anteriormente], se incluyen los siguientes tautómeros.



Del mismo modo, en el caso del compuesto de la Fórmula (1):

[donde W es W-1; R^{1a} es un grupo -SH; n, Q, R^{2a}, R^{3}, y X significa lo mismo que se ha descrito anteriormente], se incluyen los siguientes tautómeros.



Entre los compuestos incluidos en la presente invención, los compuestos que pueden formar sales de adición ácida mediante un método convencional pueden formar, por ejemplo, las sales de ácidos hidrácidos, como ácido fluorhídrico, ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, y ácido yodhídrico; las sales de ácidos inorgánicos tales como ácido nítrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido clórico, ácido perclórico; y las sales de ácidos sulfónicos tales como ácido metanosulfónico, ácido etanosulfónico, ácido trifluorometanosulfónico, ácido bencenosulfónico, y ácido p-toluenosulfónico; las sales de ácidos carboxílicos tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido trifluoroacético, ácido fumárico, ácido tartárico, ácido oxálico, ácido maleico, ácido málico, ácido succínico, ácido benzoico, ácido mandélico, ácido ascórbico, ácido láctico, ácido glucónico, y ácido cítrico; o las sales de aminoácidos tales como ácido glutámico y ácido aspártico.

Entre los compuestos incluidos en la presente invención, los compuestos que pueden formar sal de metal mediante un método convencional pueden formar, por ejemplo, las sales de metales alcalinos tales como litio, sodio, y potasio; las sales de metales alcalinotérreos tales como calcio, bario y magnesio; o la sal de aluminio.

Ejemplos específicos de cada sustituyente descrito en esta especificación se describen a continuación. Aquí, n- significa normal; i- significa iso; s- significa secundario; y terc significa

terciario y Ph significa fenilo.

Los ejemplos del átomo de halógeno en la presente especificación pueden incluir un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, y un átomo de yodo. La expresión de "halo" en esta especificación es también estos átomos de halógeno.

La expresión de alquilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo de hidrocarburos lineal o ramificado una que tiene un número de átomos de carbono de a a b. Ejemplos específicos del alquilo C_{a-b} pueden incluir grupo metilo, grupo etilo, grupo nn-propilo, grupo i-propilo, grupo n-butilo, grupo i-butilo, grupo s-butilo, grupo terc-butilo, grupo n-pentilo, grupo 1,1-dimetil propilo, grupo n-hexilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión cicloalquilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo hidrocarburo cíclico que tiene un número de átomos de carbono de a a b y puede formar una estructura monocíclica o una estructura de anillo condensado de un anillo de 3 miembros a un anillo de 6 miembros. Cada anillo puede ser opcionalmente sustituido por un grupo alquilo en un rango del número especificado de átomos de carbono. Ejemplo específico del cicloalquilo C_{a-b} puede incluir el grupo ciclopropilo, grupo 1-metilciclopropilo, grupo 2-metilciclopropilo, grupo 2,2-dimetilciclopropilo, grupo ciclobutilo, grupo ciclopentilo, grupo ciclohexilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión halocicloalquilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo hidrocarburo cíclico que tiene un número de átomos de carbono de a a b en el que el átomo de hidrógeno unido al átomo de carbono está opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno y puede formar una estructura monocíclica o una estructura de anillo condensado de un anillo de 3 miembros a un anillo de 10 miembros. Cada anillo puede ser opcionalmente sustituido por un grupo alquilo en un rango del número especificado de átomos de carbono. La posición de sustitución con el átomo de halógeno puede ser en una parte de la estructura del anillo, en una parte de la estructura de la cadena lateral, o en ambas de estas. Cuando dos o más átomos de halógeno se utilizan como sustituyentes, estos átomos de halógeno son opcionalmente iguales o diferentes entre sí. Ejemplos específicos del halocicloalquilo C_{a-b} pueden incluir grupo 2,2-difluorociclopropilo, grupo 2,2-diclorociclopropilo, grupo 2,2-dibromociclopropilo, grupo 2,2-difluoro-1-metilciclopropilo, grupo 2,2-dicloro-1-metilciclopropilo, grupo 2,2-dibromo-1-metilciclopropilo, grupo 2,2,3,3-tetra-fluorocyclobutilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de

átomos de carbono.

La expresión de alquenilo C_{a-b} en esta especificación es un un grupo hidrocarburo insaturado lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono de a a b y que tiene uno o dos o más enlaces dobles en la molécula. Ejemplos específicos del alquenilo C_{a-b} pueden incluir grupo grupo vinilo, grupo 1-propenilo, grupo 2-propenilo, grupo 1-metil-etenilo, grupo 2-butenilo, grupo 2-metil-2-propenilo, grupo 3-metil-2-butenilo, grupo 1,1-dimetil-2-propenilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de haloalquenilo C_{a-b} en esta especificación es un un grupo hidrocarburo insaturado lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono de a a b en los que el átomo de hidrógeno unido al átomo de carbono está opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno y tiene uno o dos o más enlaces dobles en la molécula. En este caso, cuando dos o más átomos de halógeno se utilizan como sustituyentes, estos átomos de halógeno son opcionalmente iguales o diferentes entre sí. Ejemplos específicos del haloalquenilo C_{a-b} pueden incluir grupo 2,2-diclorovinilo, grupo 2-fluoro-2-propenilo, grupo 2-cloro-2-propenilo, grupo 3-cloro-2-propenilo, grupo 2-bromo-2-propenilo, grupo 3,3-difluoro-propenilo, grupo 2,3-dicloro-2-propenilo, grupo 3,3-dicloro-2-propenilo, grupo 2,3,3-trifluoro-2-propenilo, 2,3, 3-tricloro-2-propenilo, grupo 1-(trifluorometil)etenilo, grupo 4,4-difluoro-3-butenilo, grupo 3,4,4-trifluoro-3-butenilo, 3-cloro-4,4,4-trifluoro-2-butenilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión cicloalquenilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo hidrocarburo cíclico insaturado que tiene un número de átomos de carbono entre a y b y que tiene uno o dos más enlaces dobles y puede formar una estructura monocíclica o una estructura de anillo condensado de un anillo de 3 miembros a un anillo de 6 miembros. Cada anillo puede ser sustituido por un grupo alquilo en un rango del número especificado de átomos de carbono. El enlace doble puede ser bien sea de forma endo o de la forma exo. El ejemplo específico de la cicloalquenilo C_{a-b} puede incluir grupo 1-ciclopenteno-1-ilo, grupo 2-ciclopenteno-1-ilo, grupo 1-ciclohexen-1-ilo, grupo 2-ciclohexen-1-ilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de alquinilo C_{a-b} en esta especificación es un un grupo hidrocarburo insaturado lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono de a a b y que tiene uno o dos o más enlaces triples en la molécula. Los ejemplos específicos del alquinilo C_{a-b} pueden incluir grupo

etinilo, grupo 1-propinilo, grupo 2-propinilo, grupo 1-butinilo, grupo 2-butinilo, grupo 3-butinilo, grupo 1,1-dimetil-2-propinilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de haloalquinilo C_{a-b} en esta especificación es un un grupo hidrocarburo insaturado lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono de a a b en los que el átomo de hidrógeno unido al átomo de carbono está opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno y tiene uno o dos o más enlaces triples en la molécula. En este caso, cuando dos o más átomos de halógeno se utilizan como sustituyentes, estos átomos de halógeno son opcionalmente iguales o diferentes entre sí. Los ejemplos específicos del haloalquinilo C_{a-b} pueden incluir grupo cloroetinilo, grupo 2-bromoetinilo, grupo 2-yodoetinilo, grupo 3-cloro-2-propinilo, grupo 3-bromo-2-propinilo, grupo 3-yodo-2-propinilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de haloalquilo C_{a-b} en esta especificación es un un grupo hidrocarburo lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono de a a b en los que el átomo de hidrógeno unido al átomo de carbono está opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno. Cuando dos o más átomos de halógeno se utilizan como sustituyentes, estos átomos de halógeno son opcionalmente iguales o diferentes entre sí. Los ejemplos específicos del haloalquilo C_{a-b} pueden incluir grupo fluorometilo, grupo clorometilo, grupo bromometilo, grupo yodometilo, grupo difluorometilo, grupo diclorometilo, un grupo trifluorometilo, grupo clorodifluorometilo, grupo triclorometilo, grupo bromodifluorometilo, un grupo 2-fluoroetilo, grupo 2-cloroetilo, grupo 2-bromoetilo, grupo 2,2-difluoroetilo, grupo 2,2,2-trifluoroetilo, grupo 2-cloro-2,2-difluoroetilo, grupo 2,2,2-tricloroetilo, grupo 1,1,2,2-tetrafluoroetilo, grupo 2-cloro-1,1,2-trifluoroetilo, grupo pentafluoroetilo, grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, grupo 1,1,2,3,3,3-hexafluoropropilo, grupo heptafluoropropilo, grupo 2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etilo, grupo 1,2,2,2-tetrafluoro-1- (trifluorometil)etilo, grupo 2,2,3,3,4,4,4-heptafluorobutilo, un grupo nonafluorobutilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de alcoxilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo alquil-O- en el cual este alquilo es el grupo alquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos de los grupos alcoxilo C_{a-b} pueden incluir grupo metoxilo, un grupo etoxilo, grupo n-propiloxilo, grupo i-propiloxilo, grupo n-butiloxilo, grupo i-butiloxilo, grupo s-butiloxilo, grupo

terc-butiloxilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de C_{a-b} alquiltio en esta especificación es un grupo alquil-S- en el cual este alquilo es el grupo alquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del alquiltio C_{a-b} pueden incluir grupo metiltio, grupo etiltio, grupo n-propiltio, grupo i-propiltio, grupo n-butiltio, grupo i-butiltio, grupo s-butiltio, grupo terc-butiltio y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

[0138] La expresión de C_{a-b} alquilcarbonilo en esta especificación es un grupo alquilo-C(O)- en el cual este alquilo es el grupo alquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del alquilcarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo acetilo, grupo propionilo, grupo butirilo, grupo isobutirilo, grupo valerilo, grupo isovalerilo, grupo 2-metilbutanoilo, grupo pivaloílo, grupo hexanoílo, grupo heptanoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de haloalquilcarbonilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo haloalquil-C(O)- en el cual este haloalquilo es el grupo haloalquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del haloalquilo C_{a-b} pueden incluir grupo fluoroacetilo, grupo cloroacetilo, grupo difluoroacetilo, grupo dicloroacetilo, grupo trifluoroacetilo, grupo clorodifluoroacetilo, grupo bromodifluoroacetilo, grupo tricloroacetilo, grupo pentafluoropropionilo, grupo heptafluorobutanoilo, grupo 3-cloro-2,2-dimetilpropanoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de cicloalquilarbonilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo cicloalquil-C(O)- en el cual este cicloalquilo es el grupo cicloalquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del cicloalquilarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo ciclopropilcarbonilo, grupo 2-metilciclopropilcarbonilo, grupo ciclobutilcarbonilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de cicloalquilarbonilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo halocicloalquil-C(O)- en el cual este halocicloalquilo es el grupo halocicloalquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del cicloalquilarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo 2,2-diclorociclopropilcarbonilo, grupo 2,2-dicloro-1-metilciclopropilcarbonilo y similares.

Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de C_{a-b} alcoxicarbonilo en esta especificación es un grupo alquil-O-C(O)- en el cual este alquilo es el grupo alquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del alcoxicarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo metoxicarbonilo, grupo etoxicarbonilo, grupo n-propiloxicarbonilo, grupo i-propiloxicarbonilo, grupo n-butoxicarbonilo, grupo i-butoxicarbonilo, grupo terc-butoxicarbonilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de haloalcoxicarbonilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo haloalquil-O-C(O)- en el cual este haloalquilo es el grupo haloalquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del haloalcoxicarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo clorometoxicarbonilo, grupo 2-cloroetoxicarbonilo, grupo 2,2-difluoroetoxicarbonilo, 2,2,2-trifluoroetoxicarbonilo, grupo 2,2,2-tricloroetoxicarbonilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de alquilaminocarbonilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo carbamoilo en el cual un átomo de hidrogeno es sustituido con el grupo alquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del alquilaminocarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo metilcarbamoilo, grupo etilcarbamoilo, grupo n-propilcarbamoilo, grupo i-propilcarbamoilo, grupo n-butilcarbamoilo, grupo i-butilcarbamoilo, grupo s-butilcarbamoilo, grupo terc-butilcarbamoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de haloalquilaminocarbonilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo carbamoilo en el que un átomo de hidrógeno está sustituido con el grupo haloalquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del haloalquilaminocarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo 2-fluoroetilcarbamoilo, grupo 2-cloroetilcarbamoilo, grupo 2,2-difluoroetilcarbamoilo, grupo 2,2,2-trifluoroetilcarbamoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de di(alquilo C_{a-b})aminocarbonilo en esta especificación es un grupo carbamoilo en el cual ambos átomos de hidrógeno son sustituidos por los grupos alquilo anteriores, que son iguales o diferentes entre si, que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del di(alquilo C_{a-b})aminocarbonilo puede incluir grupo N,N-dimetilcarbamoílo, grupo

N-etil-N-metilcarbamoílo, grupo N, N-dietilcarbamoilo, grupo N, N-di(n-propil)carbamoilo, grupo N ,N-di(n-butil)carbamoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de alquilaminosulfonilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo sulfamoilo en el cual un átomo de hidrogeno es sustituido por el grupo alquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del alquilaminosulfonilo C_{a-b} pueden incluir grupo metilsulfamoilo, grupo etilsulfamoilo, grupo n-propilsulfamoilo, grupo i-propilsulfamoilo, grupo n-butilsulfamoilo, grupo i-butilsulfamoilo, grupo s-butilsufamoilo, grupo terc-butilsulfamoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de di(alquilo Ca-b)aminosulfonilo en esta especificación es un grupo sulfamoilo en el cual ambos átomos de hidrógeno son sustituidos por los grupos alquilo anteriores, que son iguales o diferentes entre si, que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del di(alquilo Ca-b)aminosulfamoilo puede incluir grupo N,N-dimetilsulfamoilo, grupo N-etil-N-metilsulfamoilo, grupo N, N-dietilsulfamoilo, grupo N, N-di(n-propil)sulfamoilo, grupo N ,N-di(n-butil)sulfamoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de alquilamino C_{a-b} en esta especificación es un grupo amino en el cual un átomo de hidrogeno es sustituido por el grupo alquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del alquilamino C_{a-b} pueden incluir grupo metilamino, grupo etilamino, grupo n-propilamino, grupo i-propilamino, grupo n-butilamino, grupo i-butilamino, grupo s-butilamino, grupo terc-butilamino y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de di(alquilo C_{a-b})amino en esta especificación es un grupo amino en el cual ambos átomos de hidrógeno son sustituidos por los grupos alquilo anteriores, que son iguales o diferentes entre si, que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del di(alquilo Ca-b)amino puede incluir grupo dimetilamino, grupo etil(metil)amino, grupo dietilamino, grupo n-propil(metil)amino, grupo i-propil(metil)amino, grupo di(n-propil)amino, grupo di(n-butil)amino y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de alquilo (C_{a-b}) opcionalmente sustituido por R^6, alquilo (C_{a-b}) opcionalmente

sustituido con R^{27}, alquilo(C_{a-b}) opcionalmente sustituido con R^{34}, alquilo(C_{a-b}) opcionalmente sustituido con R^{35}, o alquilo(C_{a-b}) opcionalmente sustituido con R^{36} en esta especificación es el grupo alquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b en los que los átomos de hidrógeno unidos a los átomos de carbono son opcionalmente sustituidos por cualquier R^6, R^{27}, R^{34}, R^{35} o R^{36}. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono. En este caso, cuando dos o más de los sustituyentes R^6, R^{27}, R^{34}, R^{35}, o R^{36} están contenidos en el grupo alquilo (C_{a-b}), R^6, R^{27}, R^{34}, R^{35}, o R^{36} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí.

La expresión de cicloalquilo (C_{a-b}) opcionalmente sustituido con R^6 o cicloalquilo (C_{a-b}) opcionalmente sustituido con R^{27} en esta especificación es el grupo cicloalquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b en el cual los átomos de hidrógeno unidos a los átomos de carbono son opcionalmente sustituidos por cualquier R^6 o $R^{27.}$ Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono. En este caso, cuando dos o más de los sustituyentes R^6 o R^{27} están contenidos en el grupo cicloalquilo (Ca-b), R_6 o R^{27} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí. Las posiciones sustituidas pueden estar en una parte de la estructura del anillo, en una parte de la estructura de cadena secundaria, o en ambas.

Ejemplos específicos de la expresión de "R^{11} forman opcionalmente un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R^{11} y R^{12} estan unidos formando una cadena de alquileno C_{2-6} junto con $R^{12,}$ y en este caso, la cadena de alquileno opcionalmente contiene un átomo de O, S, S(O), $S(O)_{2,}$ o N(R^{33}) y está opcionalmente sustituido con un grupo oxo o un grupo tioxo ", formas opcionalmente "R^{11a} un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R^{11a} y R^{12a} están unidos formando una cadena de alquileno C_{2-6} junto con $R^{12a,}$ y en este caso, la cadena de alquileno contiene opcionalmente uno O, S, S(O), $S(O)_{2,}$ o N(R^{33}) y está opcionalmente sustituido con un grupo oxo o un grupo tioxo ", y "R^{21} forman opcionalmente un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al los cuales R^{21} y R^{22} están unidos formando una cadena de alquileno $_C$ 2-6 junto con $R^{22,}$ en este caso, la cadena de alquileno contiene opcionalmente uno O, S, S (O), S (O) $_{2,}$ o N ($R^{39)}$ y está opcionalmente sustituido con un grupo oxo o un grupo tioxo "en esta especificación puede incluir aziridina, azetidina, azetidin-2-ona, pirrolidin, pirrolidin-2-ona, oxazolidina, oxazolidin-2-ona, oxazolidin-2 tiona, tiazolidina, tiazolidin-2-ona, tiazolidin-2-tiona, imidazolidina, imidazolidin-2-ona, imidazolidin-2-tiona, piperidina, piperidin-2-ona, piperidin-2-tiona, 2H-3,4 , 5,6-tetrahidro-1,3-oxazin-2-ona, 2H-

3,4,5,6-tetrahidro-1,3-oxazina-2-tiona, morfolina, 2H-3,4,5,6 tetrahidro-1,3-tiazin-2-ona, 2H-3,4,5,6-tetrahidro-1,3-tiazin-2-tiona, tiomorfolina, tiomorfolina-1-óxido, tiomorfolina-1,1-dióxido de , perhydropyrimidin-2-ona, piperazina, homopiperidina, homopiperidin-2-ona, heptametilenimina y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de (alcoxi C_{a-b}) alquilo C_{d-e}, (alquiltio C_{a-b}) alquilo C_{d-e}, o similar, en esta especifica es un grupo hidrocarburo lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono entre d y e o en la que el átomo de hidrógeno unido al átomo de carbono es opcionalmente sustituido por cualquier grupo alcoxilo C_{a-b} o grupo alquiltio C_{a-b} anterior respectivamente. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

El "heterociclo aromático de 5-6 miembros" en esta especificación significa un heterociclo aromático monocíclico en el cual el número de átomos que forman el anillo es de 5 a 6 y 1 a 5 heteroátomos (el heteroátomo se refiere a un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno o un átomo de azufre) se encuentran en los átomos que forman el anillo. Ejemplos específicos del heterociclo aromático de 5-6 miembros pueden incluir pirrol, pirazol, imidazol, triazol, tetrazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, triazina, furano, tiofeno, tiazol, isotiazol, oxazol, isoxazol, oxadiazol, tiadiazol y similares.

Cuando el "heterociclo aromático de 5-6 miembros" contiene un enlace doble C=N, el átomo de nitrógeno puede ser N-óxido.

El "heteroarilo de 5-6 miembros" en esta especificación significa un sustituyente monovalente formado al eliminar un átomo de hidrógeno de cualquier posición en el anterior " heterociclo aromático de 5-6 miembros". Las posiciones a las que estos sustituyentes estan unidos no están limitadas en particular, y los sustituyentes pueden estar unidos a las posiciones deseadas.

El "heterociclo no aromático de 3-7 miembros" en esta especificación se refiere a un heterociclo no aromático monocíclico que tiene las siguientes características:

1) el número de átomos que forman el anillo es de 3 a 7,

2) 1 a 3 heteroátomos (el heteroátomo se refiere a un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno, o un átomo de azufre) están contenidos en los átomos que forman el anillo,

3) un grupo carbonilo, un grupo tiocarbonilo, un enlace doble, o un enlace triple pueden estar contenidos en el anillo, y

4) cuando un átomo de azufre está contenido en los átomos que forman el anillo, el átomo de

azufre puede ser un grupo sulfinilo o un grupo sulfonilo.

Ejemplos específicos del heterociclo no aromático de 3-7 miembros pueden incluir azetidina, pirrolidina, pirrolidinona, oxazolidina, isoxazolidina, tiazolidina, isotiazolidina, piperazina, piperazinona, piperidina, piperidinona, morfolina, tiomorfolina, azepina, diazepina, oxetano, tetrahidrofurano, 1,3-dioxolano, tetrahidropirano, 1,4-dioxano, oxepano, homomorfolina y similares.

El "heterociclilo de 3-7 miembros" en esta especificación significa un sustituyente monovalente formado al eliminar un átomo de hidrógeno de cualquier posición en el anterior "heterociclo no aromático de 3-7 miembros". Las posiciones a las que estos sustituyentes estan unidos no están limitadas en particular, y los sustituyentes pueden estar unidos a las posiciones deseadas.

El "heteroarilo de 5-6 miembros opcionalmente sustituido por R^{28} y $R^{28a"}$ en esta especificación es un "heteroarilo de 5-6 miembros" en el cual los átomos de hidrógeno sobre los átomos de carbono que forman el anillo del "heteroarilo de 5- 6 miembros" están sustituidos en los átomos de carbono por cualquier R^{28} en un rango del número de los átomos de hidrógeno existentes. En este caso, cuando existe nitrógeno entre los átomos que forman el anillo del "heteroarilo de 5-6 miembros" y el átomo de nitrógeno potencialmente tiene una estructura NH, el "heteroarilo de 5-6 miembros opcionalmente sustituido por R^{28} y $R^{28a"}$ es un "heteroarilo de 5-6 miembros" en el cual el átomo de hidrógeno sobre el átomo de nitrógeno está opcionalmente sustituido por cualquier R^{28a} en un rango del número de átomos de hidrógeno existentes. En este caso, cuando existen dos o más sustituyentes R^{28} en los átomos de carbono que forman el anillo del "heteroarilo de 5-6 miembros" y dos o más sustituyentes R^{28a} sustituidos por el átomo de nitrógeno que tiene una estructura potencialmente NH que forma el anillo independientemente, dos o más de R^{28} y R^{28a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí, y cuando dos R^{28} son adyacentes, los dos R^{28} adyacentes forman opcionalmente un anillo de 6 miembros junto con los átomos de carbono a los que cada R^{28} está unido formando -CH = CH-CH = CH-.

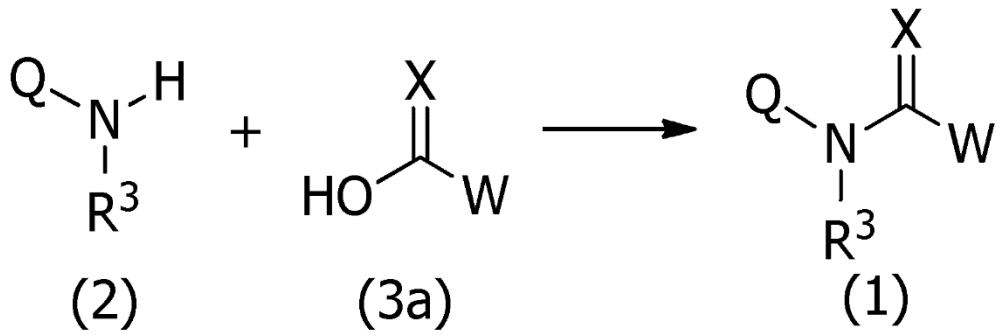
El "heterociclilo de 3-7 miembros opcionalmente sustituido por R^{28} y $R^{28a"}$ en esta especificación es un "heterociclilo de 3-7 miembros" en el cual los átomos de hidrógeno sobre los átomos de carbono que forman el anillo del "heterociclililo de 3-7 miembros" son sustituidos en los átomos de carbono por cualquier R^{28} en un rango del número de los átomos de hidrógeno existentes. En este caso, cuando existe nitrógeno entre los átomos que forman el anillo del

"heterociclilo de 3-7 miembros" y el átomo de nitrógeno potencialmente tiene una estructura NH, el "heterociclilo de 3-7 miembros opcionalmente sustituido por R^{28a}" es un "heteroarilo de 3-7 miembros" en el cual el átomo de hidrógeno sobre el átomo de nitrógeno está opcionalmente sustituido por cualquier R^{28a} en un rango del número de átomos de hidrógeno existentes. En este caso, cuando existen dos o más sustituyentes R^{28} en los átomos de carbono que forman el anillo del "heterociclilo de 3-7 miembros" y dos o más sustituyentes R^{28a} sustituidos por el átomo de nitrógeno que tiene una estructura potencialmente NH que forma el anillo independientemente, dos o más de R^{28} y R^{28a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí, y cuando dos R^{28} son adyacentes, los dos R^{28} adyacentes forman opcionalmente un anillo de 6 miembros junto con los átomos de carbono a los que cada R^{28} está unido formando -CH = CH-CH = CH-.

A continuación, se describirá el método de producción del compuesto de la presente invención.

Método de producción A

El compuesto de amida heterocíclica de la fórmula (1) se puede producir mediante, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto de Fórmula (2) con el compuesto de fórmula (3a).



(2) (3a) (1)

El compuesto de fórmula (1): [donde Q y R^3, W, y X tienen el mismo significado como se definio anteriormente] de la presente invención puede ser producido haciendo reaccionar el compuesto de Fórmula (2): [donde Q y R^3, tienen el mismo significado como se definió anteriormente] o la sal del mismo con el compuesto de Fórmula (3a): [donde W y X tienen el mismo significado como se definió anteriormente] o la sal del mismo en un solvente o sin usar un solvente mediante el uso de una base, un agente de condensación, y/o un catalizador si es necesario y añadiendo un aditivo si es necesario.

En esta reacción, el compuesto de la fórmula (3a) se puede utilizar en una rango de 0.1 a

100 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de Fórmula (2).

Cuando se utiliza el solvente, el solvente a utilizar puede ser un solvente que es inactivo a la reacción. Ejemplos del solvente pueden incluir solventes polares tales como N, N-dimetilformamida, N, N-dimetilacetamida, acetonitrilo, dimetilsulfóxido, y 1,3-dimetil-2-imidazolinona; éteres tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, y éter de difenilo; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono y 1,2-dicloroetano; e hidrocarburos alifáticos tales como n-pentano y n-hexano. Estos solventes se pueden utilizar solos o en combinaciones de dos o más de ellos.

Cuando se utiliza la base, ejemplos de la base a utilizar puede incluir bases orgánicas tales como trietilamina, piridina, y 4-(dimetilamino)piridina y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio y carbonato de sodio. Estas bases se pueden utilizar en una rango de 0.1 a 50 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de Fórmula (2).

Cuando se usa el agente de condensación, ejemplos del agente de condensación a utilizar pueden incluir 1H-benzotriazol-1-iloxitris(dimetilamino)fosfonio, N, N'-diciclohexilcarbodiimida, 1- (3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida, y yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio. Estos agentes de condensación se pueden utilizar en un rango de 0.1 a 50 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de Fórmula (2).

Cuando se utiliza el aditivo, ejemplos del aditivo a utilizar puede incluir 3H-[1,2,3] triazolo [4,5-b]piridina-3-ol y 1-hidroxibenzotriazol. Estos aditivos se pueden utilizar en un rango de 0.1 a 50 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de Fórmula (2).

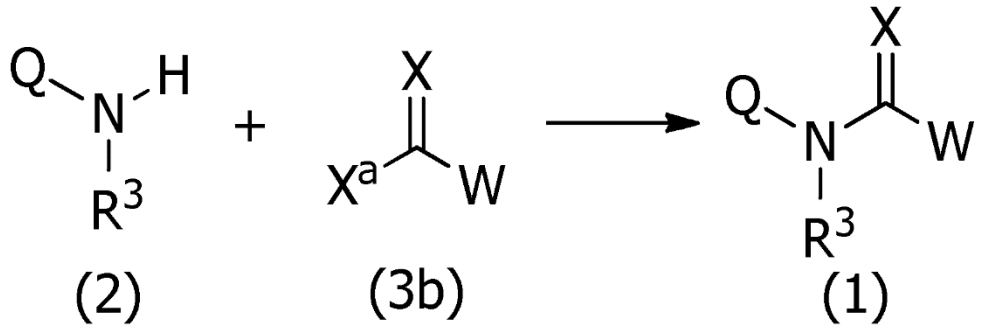
Como temperatura de reacción, se puede ajustar cualquier temperatura de -78 ° C a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la concentración del sustrato de reacción y la temperatura de reacción, por lo general se puede establecer cualquier tiempo en un intervalo de 5 minutos a 100 horas.

Algunos de los compuestos de Fórmula (2) son compuestos conocidos y algunos de los compuestos están disponibles comercialmente.

Algunos de los compuestos de fórmula (3a) son compuestos conocidos y se pueden sintetizar de acuerdo con métodos conocidos descritos en los documentos. Ejemplos de los métodos conocidos en los documentos pueden incluir un método descrito en el documento WO 2008/006540.

Método de producción B

El compuesto de amida heterocíclica de la fórmula (1) se puede producir mediante, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto de Fórmula (2) con el compuesto de fórmula (3b).



(2) (3b) (1)

El compuesto de fórmula (1): [donde Q y R^3, W, y X tienen el mismo significado como se definió anteriormente] de la presente invención puede ser producido haciendo reaccionar el compuesto de Fórmula (2): [donde Q y R^3, tienen el mismo significado como se definió anteriormente] o la sal del mismo con el compuesto de Fórmula (3b): [donde W y X tienen el mismo significado como se definió anteriormente y X^a es un grupo saliente tal como un átomo de halógeno] o la sal del mismo en un solvente o sin usar un solvente mediante el uso de una base si es necesario.

En esta reacción, el compuesto de la fórmula (3b) se puede utilizar en un rango de 0.1 a 100 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de Fórmula (2).

Cuando se utiliza el solvente, el solvente a utilizar puede ser un solvente que es inactivo a la reacción. Ejemplos del solvente pueden incluir solventes polares tales como N, N-dimetilformamida, N, N-dimetilacetamida, acetonitrilo, dimetilsulfóxido, y 1,3-dimetil-2-imidazolinona; éteres tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, y éter de difenilo; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono y 1,2-dicloroetano; e hidrocarburos alifáticos tales como n-pentano y n-hexano. Estos solventes se pueden utilizar solos o en combinaciones de dos o más de ellos.

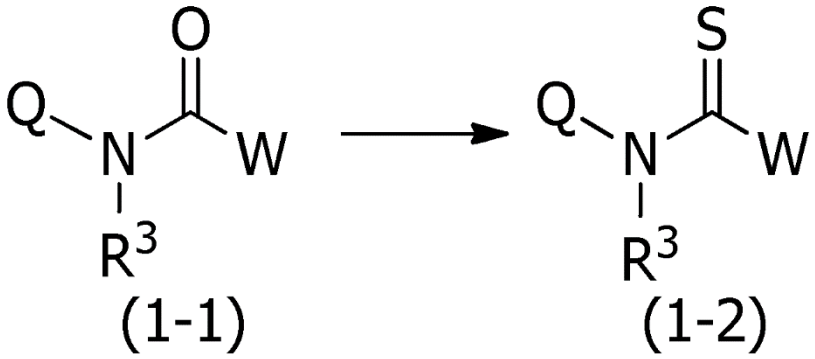
Cuando se utiliza la base, ejemplos de la base a utilizar puede incluir bases orgánicas tales como trietilamina, piridina, y 4-(dimetilamino)piridina y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, carbonato de sodio, hidrogencarbonato de potasio, hidrogencarbonato de sodio, e

hidruro de sodio. Estas bases se pueden utilizar en una rango de 0.1 a 50 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de Fórmula (2). Estas bases se pueden utilizar solas o en combinaciones de dos o más de ellos.

Como temperatura de reacción, se puede ajustar cualquier temperatura de -78 °C a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la concentración del sustrato de reacción y la temperatura de reacción, por lo general se puede establecer cualquier tiempo en un intervalo de 5 minutos a 100 horas.

Método de producción C

El compuesto de la Fórmula (1-2): [donde W, Q y R^3, tienen el mismo significado como se definio anteriormente] de la presente invención pueden ser producidos, por ejemplo, por la reacción del compuesto de la Fórmula (1-1): [donde W, Q y R^3 tienen el mismo significado como se definio anteriormente] de la presente invención con agentes sulforizantes tales como pentasulfuro de fósforo, pentasulfuro de fósforo-HMDO (hexametildisiloxano), y reactivo de Lawesson (2,4-bis (4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiadifosfetano-2,4-disulfuro).



El agente sulforizante utilizado en esta reacción se puede utilizar en un rango de 0.5 a 50 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de la Fórmula (1-1).

Bases tales como carbonato de potasio, trietilamina, piridina, y 4-(dimetilamino)piridina se pueden utilizar si es necesario.

Esta reacción puede llevarse a cabo sin utilizar un solvente. Sin embargo, un solvente puede ser utilizado. Ejemplos del solvente pueden incluir solventes polares tales como N, N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, acetonitrilo, dimetilsulfóxido, 1,3-dimetil-2-imidazolinona, y agua; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, 2-propanol, y glicol de

etileno; éteres tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, y éter de difenilo; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; e hidrocarburos alifáticos tales como pentano y n-hexano. Estos solventes se pueden utilizar solos o en combinaciones de dos o más de ellos.

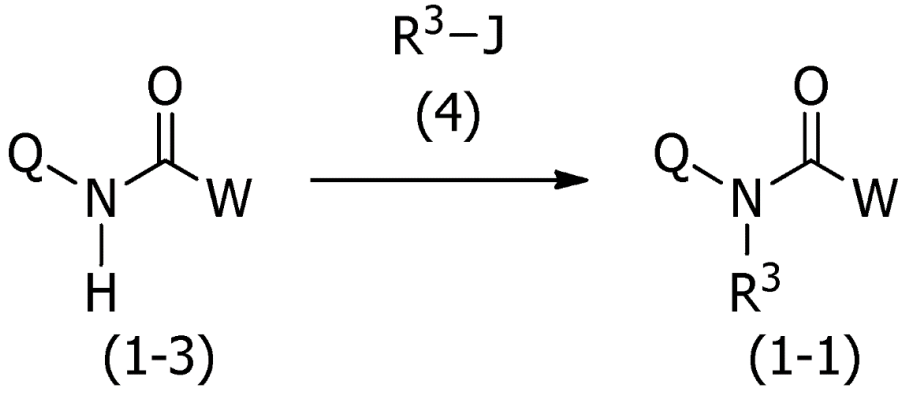
Como temperatura de reacción, se puede ajustar cualquier temperatura de -60 ° C a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la concentración del sustrato de reacción y la temperatura de reacción, por lo general se puede establecer cualquier tiempo en un intervalo de 5 minutos a 100 horas.

En el método de producción A al método de producción C, el tratamiento usual posterior de la mezcla de reacción después de la finalización de la reacción tales como la concentración directa, la concentración después de disolver en un disolvente orgánico y el lavado con agua, o la concentración después de verter en hielo agua y extracción con un disolvente orgánico pueden dar el compuesto de la presente invención. Cuando se requiere purificación, el compuesto se puede separar y purificar mediante cualquier método de purificación tal como recristalización, cromatografía en columna, cromatografía de capa delgada, y cromatografía líquida.

Algunos de los compuestos de la fórmula (3b) se pueden sintetizar de acuerdo con la fórmula 1 de reacción descrita a continuación.

Método de producción D

El compuesto de amida heterocíclica de la fórmula (1-1) se puede producir mediante, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto de Fórmula (1-3): [donde W y Q, tienen el mismo significado como se definio anteriormente] con el compuesto de Fórmula (4): [donde R^3 tienen el mismo significado como se definio anteriormente y J es un grupo saliente tal como un átomo de halógeno, -OH, $-OSO_2$ Me, y $-OSO_2$ CF_3].



En esta reacción, el compuesto de la fórmula (4) se puede utilizar en un rango de 0.5 a 50 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de Fórmula (1-3). Ácidos tales como ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, y ácido p-toluenosulfónico o bases tales como carbonato de potasio, trietilamina, piridina, y 4-(dimetilamino)piridina, hidruro de sodio, hidróxido de sodio, y hidróxido de potasio se pueden utilizar si es necesario. Alternativamente, se puede utilizar la reacción de Mitsunobu usando azodicarboxilato de dietilo, trifenilfosfina, y similares.

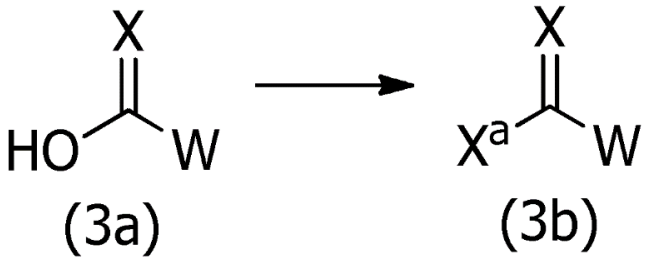
Esta reacción puede llevarse a cabo sin utilizar un solvente. Sin embargo, un solvente puede ser utilizado. Ejemplos del solvente pueden incluir solventes polares tales como N, N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, acetonitrilo, dimetilsulfóxido, 1,3-dimetil-2-imidazolinona, y agua; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, 2-propanol, y glicol de etileno; éteres tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, y éter de difenilo; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; e hidrocarburos alifáticos tales como pentano y n-hexano. Estos solventes se pueden utilizar solos o en combinaciones de dos o más de ellos.

Como temperatura de reacción, se puede ajustar cualquier temperatura de -60 °C a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la concentración del sustrato de reacción y la temperatura de reacción, por lo general se puede establecer cualquier tiempo en un intervalo de 5 minutos a 100 horas.

Algunos de los compuestos de Fórmula (4) son compuestos conocidos y algunos de los compuestos están disponibles comercialmente. Los compuestos distintos de los compuestos descritos anteriormente se pueden sintetizar de acuerdo con métodos descritos en los documentos de referencia.

Fórmula de Reacción 1

El compuesto de la fórmula (3b) se puede producir mediante, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto de Fórmula (3a) con un agente de halogenación.



(3a) (3b)

El compuesto de fórmula (3b): [donde W, X y X^a tienen el mismo significado como se definio anteriormente] se puede producir haciendo reaccionar el compuesto de fórmula (3a) [en donde W y X tienen el mismo significado como se definió anteriormente] o la sal del mismo con el agente de halogenación en un solvente o sin ayuda de un solvente mediante el uso de una base si es necesario.

Ejemplos del agente de halogenación pueden incluir cloruro de tionilo, cloruro de oxalilo, y cloruro de fosforilo. El agente de halogenación se pueden utilizar en un rango de 0.1 a 100 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de Fórmula (3a).

Cuando se utiliza el solvente, el solvente a utilizar puede ser un solvente que es inactivo a la reacción. Ejemplos del solvente pueden incluir solventes polares tales como N, N-dimetilformamida, N, N-dimetilacetamida, acetonitrilo, dimetilsulfóxido, y 1,3-dimetil-2-imidazolinona; éteres tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, y éter de difenilo; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono y 1,2-dicloroetano; e hidrocarburos alifáticos tales como n-pentano y n-hexano. Estos solventes se pueden utilizar solos o en combinaciones de dos o más de ellos.

Cuando se utiliza la base, ejemplos de la base a utilizar puede incluir bases orgánicas tales como trietilamina, piridina, y 4-(dimetilamino)piridina y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, carbonato de sodio, hidrogencarbonato de potasio, hidrogencarbonato de sodio, e hidruro de sodio. Estas bases se pueden utilizar en una rango de 0.1 a 50 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de Fórmula (3a). Estas bases se pueden utilizar solas o en combinaciones de dos o más de ellos.

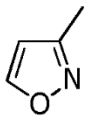
Como temperatura de reacción, se puede ajustar cualquier temperatura de -78 ° C a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la concentración del sustrato de reacción y la temperatura de reacción, por lo general se puede establecer cualquier tiempo en un intervalo de 5 minutos a 100 horas.

El tratamiento posterior habitual para la mezcla de reacción después de la finalización de la reacción puede proporcionar un intermedio de producción como un compuesto material de partida para el método de producción B.

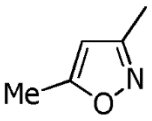
El intermedio de producción producido por este método se puede utilizar en la siguiente etapa sin aislamiento y purificación.

Ejemplos específicos del compuesto activo incluidos en la presente invención pueden incluir los compuestos indicados en la Primera tabla a Tercera Tabla. Los compuestos listados en la Primera Tabla a Tercera tabla, sin embargo, son compuestos para ejemplificación, y por lo tanto la presente invención no se limita a estos compuestos. En las tablas, el sustituyente descrito como Me es un grupo metilo. Del mismo modo en las Tablas, Et es grupo etilo, n-Pr y Pr-n son cada uno grupo normal-propilo, i-Pr y Pr-i son cada uno grupo iso-propilo, c-Pr y Pr-c son cada uno grupo ciclopropilo, n Bu y Bu-n son cada uno grupo normal-butilo, s-Bu y Bu-s son cada uno grupo secundario-butilo, un i-Bu y Bu-i son cada uno grupo iso-butilo, t-Bu-t Bu y son cada uno grupo butilo terciario, c-Bu y Bu-c son cada uno grupo ciclobutilo, n-Pen y Pen-n son cada uno grupo normal-pentilo, i-Pen y Pen-i son cada uno grupo iso-pentilo, S-Pen y Pen-s son cada uno grupo secundario-pentilo, t-Pen y Pen-t son cada uno grupo terc-pentilo, c-Pen y Pen-c son cada uno grupo ciclopentilo, 3-Pen es grupo $-CH(Et)_2$, n- Hex y Hex-n son cada uno grupo normal-hexilo, c-Hex y Hex-c son cada uno ciclohexilo, y Ph es un grupo fenilo.

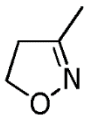
En las tablas, las estructuras de D-3, D-3a, D-4, D-4a, D-4b, D-8, D-8a, D-8b, D-8c, D-8d, D-8e, D-8f, D-8g, D-8h, D-9, D-9a, D-9b, D-9c, D-9d, D-9e, D-9f, D-9g, D-9h, D-9i, D-9j, D- 9k, D-9m, D-10a, D-11, D-12, D-13a, D-14, D-15, D-16, D-16a, D-16b, D-16c, D-16d, D-16e, D-16f, D-16g, D-16h, D-16i, D-16j, D-16k, D-16m, D-16n, D-16p, D-17, D-17a, D-17b, D-18, D-19, D-21, D-24a, D-24b, D-24c, D-24d, D-24e y D-24f son las siguientes:



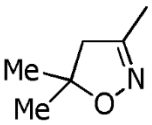
D-3



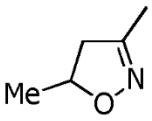
D-3a



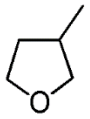
D-4



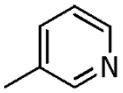
D-4a



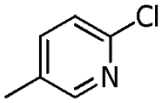
D-4b



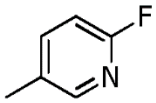
D-5



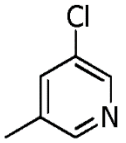
D-8



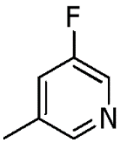
D-8a



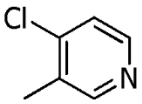
D-8b



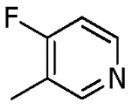
D-8c



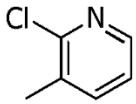
D-8d



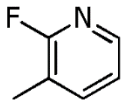
D-8e



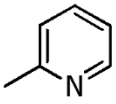
D-8f



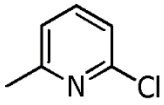
D-8g



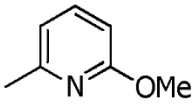
D-8h



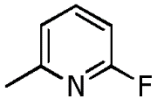
D-9



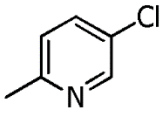
D-9a



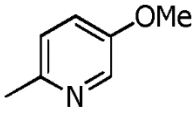
D-9b



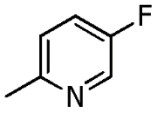
D-9c



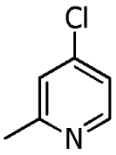
D-9d



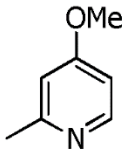
D-9e



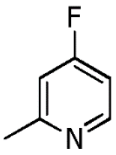
D-9f



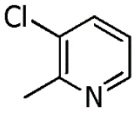
D-9g



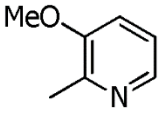
D-9h



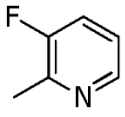
D-9i



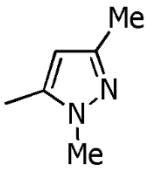
D-9j



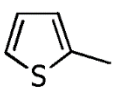
D-9k



D-9m

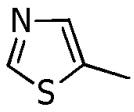


D-10a

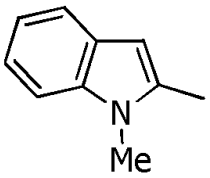


D-11

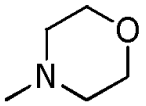
5



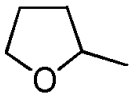
D-12



D-13a

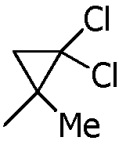


D-14

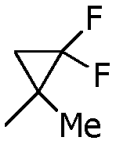


D-15

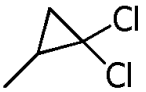
D-16



D-16a

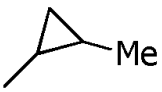


D-16b

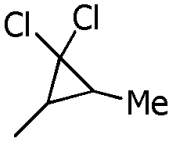


D-16c

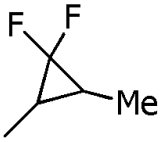
D-16d



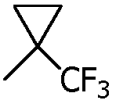
D-16e



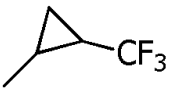
D-16f



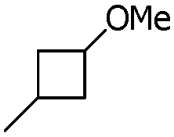
D-16g



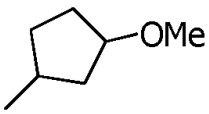
D-16h



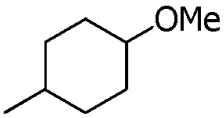
D-16i



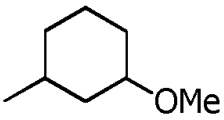
D-16j



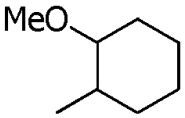
D-16k



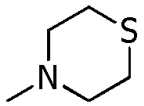
D-16m



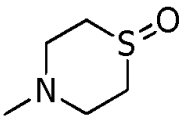
D-16n



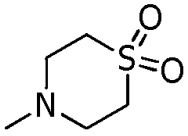
D-16p



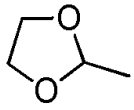
D-17



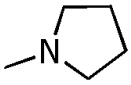
D-17a



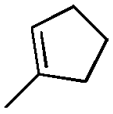
D-17b



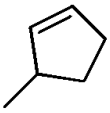
D-18



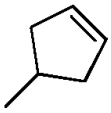
D-19



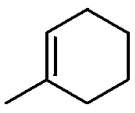
D-24a



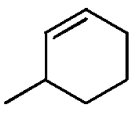
D-24b



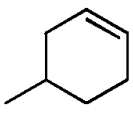
D-24c



D-24d

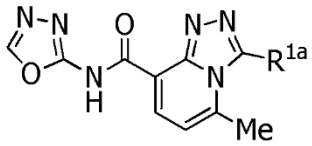
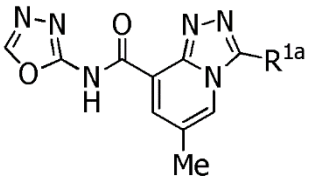
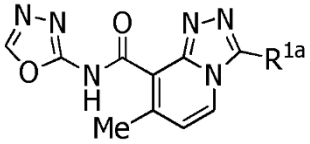
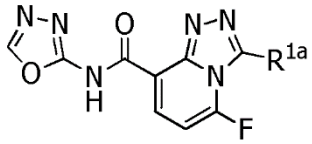
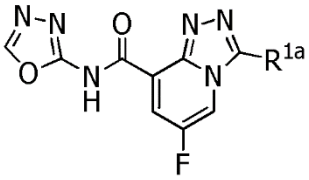
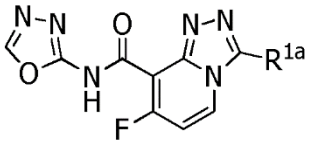
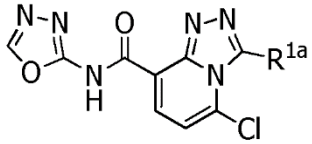
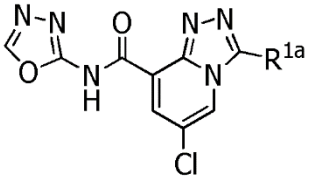
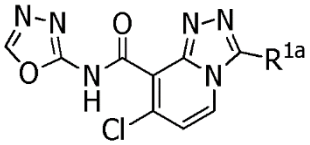
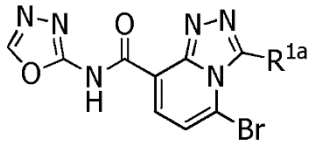
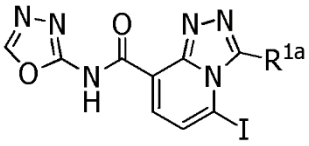
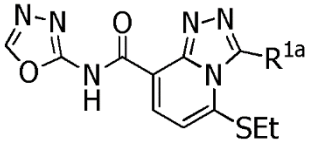
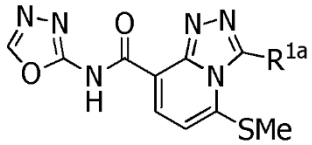
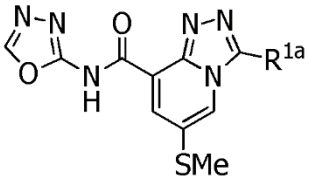
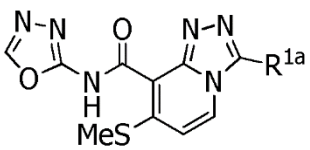
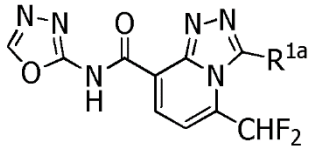
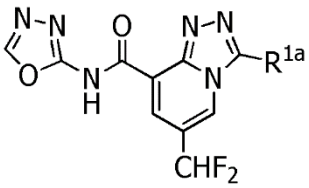
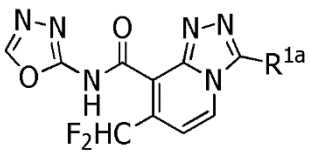
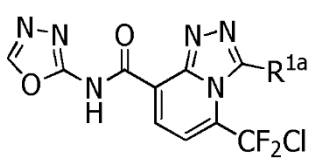
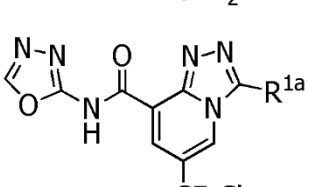
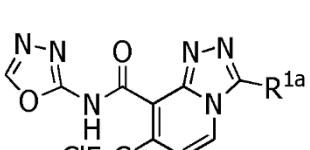
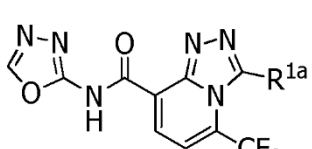
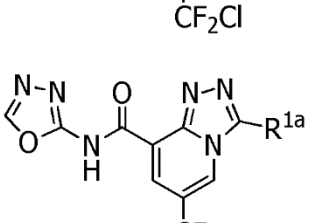
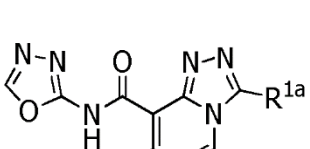


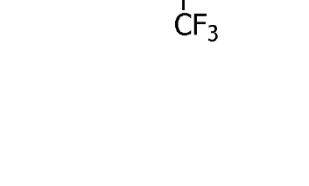
D-24e



D-24f

[0189] [Primera Tabla]



(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2014 年 12 月 4 日(04.12.2014)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2014/192936 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 471/04 (2006.01) *A01P 13/02* (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2014/064492

(22) 国際出願日: 2014 年 5 月 30 日(30.05.2014)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2013-115196 2013 年 5 月 31 日(31.05.2013) JP
特願 2013-217697 2013 年 10 月 18 日(18.10.2013) JP
特願 2014-013999 2014 年 1 月 29 日(29.01.2014) JP
特願 2014-072736 2014 年 3 月 31 日(31.03.2014) JP

(71) 出願人: 日産化学工業株式会社(NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.) [JP/JP]; 〒1010054 東京都千代田区神田錦町三丁目７番地１ Tokyo (JP).

(72) 発明者: 中屋 凜彦 (NAKAYA, Yoshihiko); 〒2748507 千葉県船橋市坪井西二丁目１０番１号 日産化学工業株式会社物質科学研究所内 Chiba (JP). 谷間 大輔(TANIMA, Daisuke); 〒2748507 千葉県船橋市坪井西二丁目１０番１号 日産化学工業株式会社物質科学研究所内 Chiba (JP). 稲葉 正光(INABA, Masamitsu); 〒2748507 千葉県船橋市坪井西二丁目１０番１号 日産化学工業株式会社物質科学研究所内 Chiba (JP). 宮角 裕喜(MIYAKADO, Yuuki); 〒3490294 埼玉県三郷市白岡１４７０ 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP). 古橋 孝将(FURUHASHI, Takamasa); 〒3490294 埼玉県白岡市白岡１４７０ 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP). 前田 兼成 (MAEDA, Kazushige), 〒2748507 千葉県船橋市坪井西二丁目１０番１号 日産化学工業株式会社物質科学研究所内 Chiba (JP).

(74) 代理人: 苧 経夫, 外(HANABUSA, Tsuneo et al.); 〒1010062 東京都千代田区神田駿河台３丁目２番地 新御茶ノ水アーバントリニティ 苧特許事務所内 Tokyo (JP).

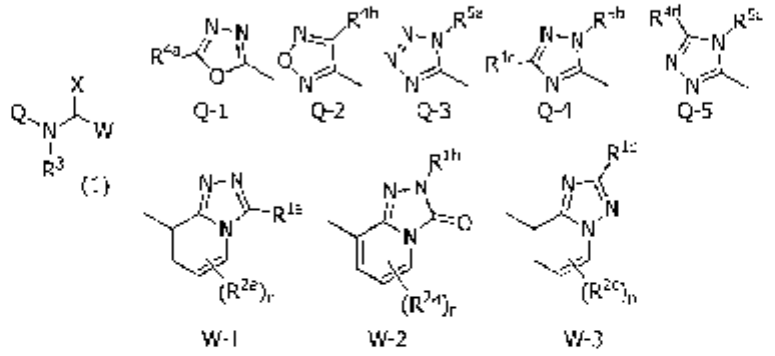
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW,

|続葉有|

(54) Title: HETEROCYCLIC AMIDE COMPOUND

(54) 発明の名称 : 複素環アミド化合物



(57) **Abstract**: Provided are heterocyclic amide compounds represented by formula (I), and an agricultural chemical, specifically a herbicide, which contains said compound's (in formula (I). Q represents an aromatic heterocycle indicated by any of Q1 to Q5, W represents an aromatic heterocycle indicated by W-1, W-2, or W-3, X represents an oxygen atom, or the like, R^{1a} represents a hydrogen atom, a halogen atom, or a C_1-C_6 alkyl, or the like, R^{1b} represents a hydrogen atom, or the like, R^{1c} represents a C_1-C_6 alkyl, R^{2a} represents a halogen atom, or a C_1-C_6 alkyl, or the like, R^{2b} represents a C_1-C_6 haloalkyl, R^3 represents a hydrogen atom, or the like, R^{4a} represents a hydrogen atom, or a C_1-C_6 alkyl, or the like, R^{4b} represents a hydrogen atom, or a C_1-C_6 alkyl, or the like, R^{4c} represents a hydrogen atom, or a C_1-C_6 alkyl, or the like, R^{4d} represents a hydrogen atom, or a C_1-C_6 alkyl, or the like, R^{5a} and R^{5b} each independently represent a hydrogen atom, or a C_1-C_6 alkyl, or the like, R^{2c} represents a hydrogen atom, or a C_1-C_6 alkyl, or the like, and n represents the integer 0, 1, 2, or 3).

(57) 要約:

|続葉有|

WO 2014/192936 A1

MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))

本発明は、式（１）：［式中、ＱはＱ－１からＱ－５の何れかで示される芳香族複素環、ＷはＷ－１、Ｗ－２又はＷ－３で示される芳香族複素環、Ｘは酸素原子等、Ｒ^{1}は水素原子、ハロゲン原子又はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル等、Ｒ^{1}は水素原子等、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｒ^{2}はハロゲン原子又はＣ～Ｃ$_{6}$アルキル等、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｒ^{3}は水素原子等、Ｒ^{3}は水素原子又はＣ～Ｃ$_{6}$アルキル等、Ｒ^{3}は水素原子又はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル等、Ｒ^{4}は水素原子又はＣ～Ｃ$_{6}$アルキル等、Ｒ^{4}は水素原子又はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル等、Ｒ^{5}及びＲ^{6}は各々独立して水素原子又はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル等、Ｒ^{5}は水素原子又はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル等、並びに、ｎは０，１，２又は３の整数を表す。］で表される複素環アミド化合物及びそれらを含有する農薬、特に除草剤を提供する。

明　細　書

発明の名称 ： 複素環アミド化合物

技術分野

[0001] 本発明は、新規な複素環アミド化合物及びその塩、並びに該複素環アミド化合物及びその塩を有効成分として含有する農薬、特に除草剤に関するものである。また、本発明における農薬とは、農園芸分野における殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤及び殺菌剤等を意味する。

背景技術

[0002] 例えば、特許文献１乃至６には、ある種の複素環アミド化合物が開示されているが、本発明に係る複素環アミド化合物に関しては何ら開示されていない。

先行技術文献

特許文献

[0003] 特許文献1：国際公開第２０１２／０２８５７９号
特許文献2：国際公開第２０１２／１２３４０９号
特許文献3：国際公開第２０１２／１２３４１６号
特許文献4：国際公開第２０１２／１２６９３２号
特許文献5：国際公開第２０１３／０１７５５９号
特許文献6：国際公開第２０１３／０６４４５７号

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0004] 本発明の目的は、より低薬量で各種雑草に対して効果を確実に示し、且つ、土壌汚染や後作物への影響等の問題が軽減された、安全性の高く、除草剤の有効成分として有用な化学物質を提供することである。

課題を解決するための手段

[0005] 本発明者らは、上記の課題解決を目標に鋭意研究を重ねた結果、本発明に係る下記式（１）で表される新規な複素環アミド化合物が除草剤として優れ

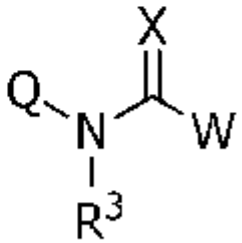
た除草活性並びに対象となる作物に対する高い安全性を有し、且つ、ホ乳動物、魚類及び益虫等の非標的生物に対してほとんど悪影響の無い、極めて有用な化合物であることを見い出し、本発明を完成した。

[0006] すなわち、本発明は下記〔１〕～〔１１５〕に関するものである。

〔１〕

式（１）：

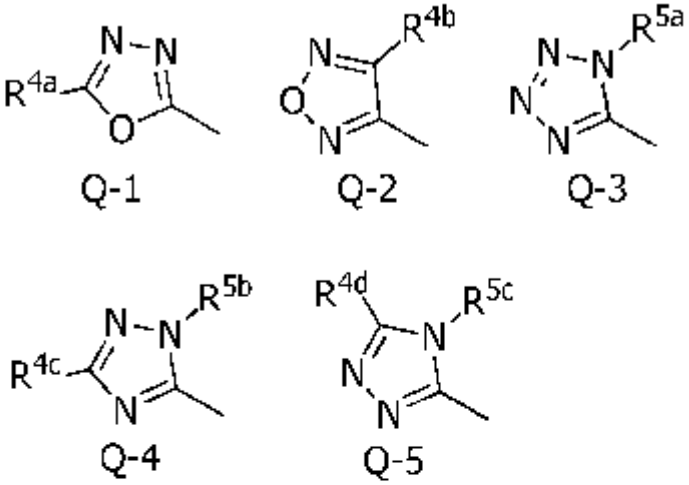
[化1]



(1)

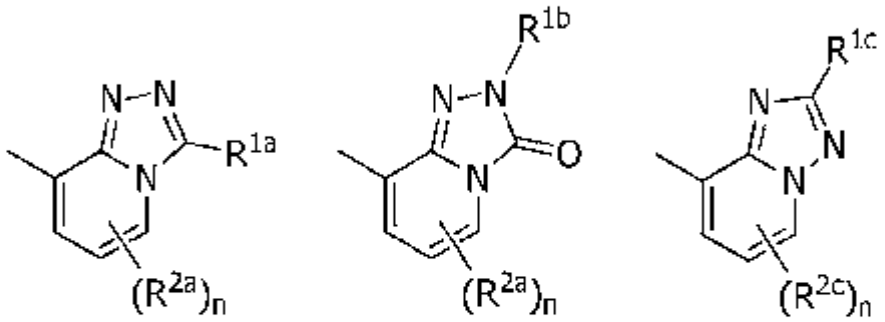
［式中、Ｑは、Ｑ－１からＱ－５の何れかで示される芳香族複素環を表し、

[化2]



Ｗは、Ｗ－１、Ｗ－２又はＷ－３で示される芳香族複素環を表し、

[化3]



W-1 W-2 W-3

Xは、酸素原子又は硫黄原子を表し、

R^{1a}は、水素原子、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、R^6によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、R^6によって任意に置換された（C_3～C_6）シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_3～C_8シクロアルケニル、－C（O）R^8、－C（O）OR^{15}、シアノ、－OR^9、－S（O）$_{m1}R^{16}$、－N（R^{11}）R^{12}、－C（＝NR^{12b}）R^{8b}、フェニル、（R^7）$_p$によって置換されたフェニル、ナフチル又は－1から－25の何れかの基を表し、

R^{1b}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^6によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、R^6によって任意に置換された（C_3～C_6）シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキニル、フェニル、（R^7）$_p$によって置換されたフェニル、ナフチル、5－6員ヘテロアリール、（R^{28}及びR^{28a}によって任意に置換された）5－6員ヘテロアリール、3－7員ヘテロシクリル又は（R^{28}及びR^{28a}によって任意に置換された）3－7員ヘテロシクリルを表し、

R^{1c}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{2A}は、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、－C（O）R^{18}、－C（O）OR^{24}、シアノ、ニトロ、－OR^{19}、－S（O）$_{m3}R^{20}$、－N（R^{21}）R^{22}、フェニル又は（R^7）$_s$によって置換されたフェニルを表し、nが2以上の整数を表すとき、各々のR^{2A}は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、更に、2つのR^{2A}が隣接する場合には、隣

接する２つのR^{2a}は、－ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ－を形成することにより、それぞれのR^{2a}が結合する炭素原子と共に６員環を形成してもよく、

R^{2b}は、C_1～C_6ハロアルキルを表し、

R^3は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6ハロシクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、－Ｃ（Ｏ）R^{25}又は－Ｃ（Ｏ）ＯR^{26}を表し、

R^{4a}は、水素原子、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_3～C_6）シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、C_3～C_6シクロアルケニル、－NH_2、C_1～C_6アルキルアミノ、ジ（C_1～C_6アルキル）アミノ、－ＮＨＣ（Ｏ）R^8、フェニル、（R^{28}）$_r$によって置換されたフェニル、５－６員ヘテロアリール、（R^{28}及びR^{28a}によって任意に置換された）５－６員ヘテロアリール、３－７員ヘテロシクリル又は（R^{28}及びR^{28a}によって任意に置換された）３－７員ヘテロシクリルを表し、

R^{4b}は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C_1～C_6アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_3～C_6）シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、C_3～C_6シクロアルケニル、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{16}、－ＯR^{38}、－Ｓ（Ｏ）$_{m3}R^{20}$、－NH_2、C_1～C_6アルキルアミノ、ジ（C_1～C_6アルキル）アミノ、－ＮＨＣ（Ｏ）R^8、フェニル、（R^{28}）$_r$によって置換されたフェニル、５－６員ヘテロアリール、（R^{28}及びR^{28a}によって任意に置換された）５－６員ヘテロアリール、３－７員ヘテロシクリル又は（R^{28}及びR^{28a}によって任意に置換された）３－７員ヘテロシクリルを表し、

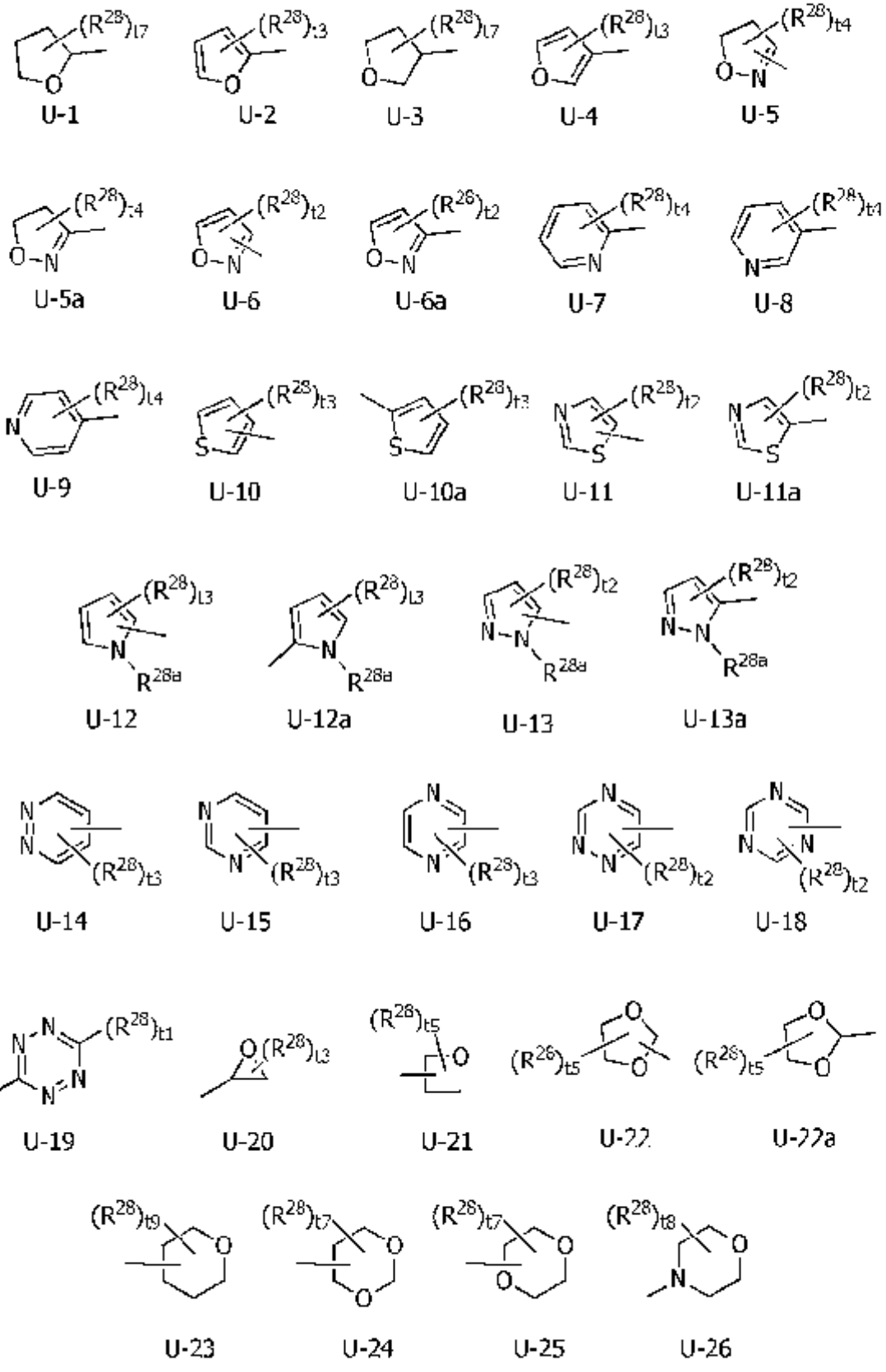
R^{4c}は、水素原子、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、R^{27}によっ

て任意に置換された（C_3～C_6）シクロアルキル、フェニル、（R^{26}）$_r$によって置換されたフェニル、５－６員ヘテロアリール、（R^{28}及びR^{26a}によって任意に置換された）５－６員ヘテロアリール、３－７員ヘテロシクリル又は（R^{28}及びR^{26a}によって任意に置換された）３－７員ヘテロシクリルを表し、

R^{4d}は、水素原子、C_1～C_6アルキル又はR^{35}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

Ｕ－１乃至Ｕ－６、Ｕ－６ａ、Ｕ－７乃至Ｕ－１０、Ｕ－１０ａ、Ｕ－１１、Ｕ－１１ａ、Ｕ－１２、Ｕ－１２ａ、Ｕ－１３、Ｕ－１３ａ、Ｕ－１４乃至Ｕ－２２、Ｕ－２２ａ、Ｕ－２３、Ｕ－２４、Ｕ－２５、Ｕ－２６は、それぞれ以下の構造で表される複素環を表し、

[化4]


U-1
U-2
U-3
U-4
U-5
U-5a
U-6
U-6a
U-7
U-8
U-9
U-10
U-10a
U-11
U-11a
U-12
U-12a
U-13
U-13a
U-14
U-15
U-16
U-17
U-18
U-19
U-20
U-21
U-22
U-22a
U-23
U-24
U-25
U-26

R^{5a}及びR^{5b}は、各々独立して水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6ハロシクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、C_3～C_6シクロアルケニル、フェニル又は$(R^{28})_r$によって置換されたフェニルを表し、

R^{5c}は、水素原子、C_1～C_6アルキル又はR^{30}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表すか、或いはR^{5c}は、R^{4d}と－$(CH_2)_4$－又は－CH＝CH－CH＝CH－を形成することにより、R^{5c}が結合する窒素原子及びR^{4d}が結合する炭素原子と共に６員環を形成してもよく、

R^6は、ハロゲン原子、シアノ、C_3～C_6シクロアルキル、－C（O）R^8、－C（O）OR^{16}、－OR^{13}、－S（O）$_{r2}R^{14}$、フェニル又は$(R^7)_p$によって置換されたフェニルを表し、

R^7は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C_1～C_6アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6ハロシクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、C_3～C_6シクロアルケニル、C_1～C_6アルキルカルボニル、C_3～C_6シクロアルキルカルボニル、C_1～C_6ハロアルキルカルボニル、C_3～C_6ハロシクロアルキルカルボニル、C_1～C_6アルコキシカルボニル、C_1～C_6ハロアルコキシカルボニル、C_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_1～C_6ハロアルキルアミノカルボニル、ジ（C_1～C_6アルキルアミノ）カルボニル、－OR^{15}、－S（O）$_{m3}R^{20}$、C_1～C_6アルキルアミノスルホニル、ジ（C_1～C_6アルキル）アミノスルホニル、－NH_2、C_1～C_6アルキルアミノ、ジ（C_1～C_6アルキル）アミノ、５－６員ヘテロアリール、（R^{28}及びR^{28a}によって任意に置換された）５－６員ヘテロアリール、３－７員ヘテロシクリル又は（R^{28}及びR^{28a}によって任意に置換された）３－７員ヘテロシクリルを表し、

R^8は、水素原子、C_1～C_5アルキル又は－N（R^{11A}）R^{12a}を表し、

R^{8a}は、水素原子又はC_1～C_5アルキルを表し、

R^9は、水素原子、C_1～C_3アルキル又はフェニルを表し、

R^{10}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6ハロシクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル又はC_2～C_6ハロアルキニルを表し、

R^{11}及びR^{12}は、各々独立して水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、フェニルスルホニル、フェニル、$(R^7)_p$によって置換されたフェニル、U－7、U－8、U－9又はU－14乃至U－19を表すか、或いは、R^{11}はR^{12}と一緒になってC_2～C_6アルキレン鎖を形成することにより、R^{11}及びR^{12}が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はO、S、S（O）、S（O）$_2$又はN（R^{33}）を1個含んでもよく、且つオキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく、

R^{11a}及びR^{12a}は、各々独立して水素原子、C_1～C_5アルキル又はフェニルを表すか、或いは、R^{11a}はR^{12a}と一緒になってC_2～C_5アルキレン鎖を形成することにより、R^{11a}及びR^{12a}が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はO、S、S（O）、S（O）$_2$又はN（R^{33}）を1個含んでもよく、且つオキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく、

R^{12b}は、－OR^{19b}を表し、

R^{13}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、－C（O）R^8又はフェニルを表し、

R^{14}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2

～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル又はフェニルを表し、

R^{15}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6ハロシクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル又はC_3～C_6シクロアルケニルを表し、

R^{16}は、水素原子、C_1～C_6アルキル又はR^{37}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{18}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{19}は、水素原子、C_1～C_6アルキル又はフェニルを表し、

R^{19b}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{20}は、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル又はC_3～C_6シクロアルケニルを表し、

R^{21}及びR^{22}は、各々独立して水素原子、C_1～C_6アルキル又はフェニルを表すか、或いは、R^{21}はR^{22}と一緒になってC_2～C_6アルキレン鎖を形成することにより、R^{21}及びR^{22}が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はO、S、S（O）、S（O）$_2$又はN（R^{39}）を1個含んでもよく、且つオキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく、

R^{24}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{25}及びR^{26}は、各々独立しては、水素原子、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6ハロシクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、C_3～C_6シクロアルケニル又はフェニルを表し、

R^{27}は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、フェニル、（R^{28}）$_r$によって置換されたフェニル、－C（O）OR^{16}、－OR^{29}、－S（O）$_{r4}R^{30}$、5－6員ヘテロアリール、（R^{28}及びR^{28a}によって任意に置換された）5－6員ヘテロアリール、3－7員ヘテロシクリル又は（R^{28}及びR^{28a}によって任意

に置換された）３－７員ヘテロシクリルを表し、

R^{28}は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6ハロシクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、（C_1～C_6アルコキシ）C_1～C_6アルキル、－OR^{31}又は－$S(O)_{n4}R^{30}$を表し、ｔ２、ｔ３、ｔ４、ｔ５、ｔ７、ｔ８又はｔ９が２以上の整数を表すとき、各々のR^{28}は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、更に２つのR^{28}が隣接する場合には、隣接する２つのR^{28}は一緒になって－ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ－を形成することにより、それぞれのR^{28}が結合する炭素原子と共に６員環を形成してもよく、

R^{28a}は、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、（C_1～C_6アルコキシ）C_1～C_6アルキル又は（C_1～C_6アルキルチオ）C_1～C_6アルキルを表し、

R^{29}、R^{30}及びR^{31}は、各々独立して、水素原子、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6ハロシクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、C_3～C_6シクロアルケニル又はフェニルを表し、

R^{33}は、水素原子、C_1～C_6アルキルを表し

R^{34}は、ハロゲン原子、シアノ、C_3～C_6シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）R^6、－Ｃ（Ｏ）OR^{16}、－OR^{33}、－$S(O)_{n6}R^{33}$、フェニル、$(R^7)_p$によって置換されたフェニル、Ｕ－１、Ｕ－３、Ｕ－７、Ｕ－８、Ｕ－９又はＵ－１４乃至Ｕ－２５を表し、

R^{35}は、ハロゲン原子又はC_1～C_6アルコキシを表し、

R^{36}は、ハロゲン原子又はC_1～C_6アルコキシを表し、

R^{37}は、C_1～C_6アルコキシを表し、

R^{38}は、C_1～C_6アルキル、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6ハロシクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハ

ロアルキニル、C_3～C_6シクロアルケニル又はフェニルを表し、

R^{39}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

ｔ１は、０又は１の整数を表し

ｍ１、ｍ２、ｍ３、ｍ４、ｍ６及びｔ２は、各々独立して０、１又は２の整数を表し、

ｎ及びｔ３は、各々独立して０、１、２又は３の整数を表し、

ｐ及びｒは、各々独立して１、２、３、４又は５の整数を表し、

ｔ４は、０、１、２、３又は４の整数を表し、

ｔ５は、０、１、２、３、４又は５の整数を表し、

ｔ７は、０、１、２、３、４、５、６又は７の整数を表し、

ｔ８は、０、１、２、３、４、５、６、７又は８の整数を表し、

ｔ９は、０、１、２、３、４、５、６、７、８又は９の整数を表す。〕で表される複素環アミド化合物又はその塩。

[0007] 〔２〕

Ｗは、Ｗ－１又はＷ－２で示される芳香族複素環を表し、

R^{29}は、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、－Ｃ（Ｏ）R^{33}、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{34}、シアノ、ニトロ、－ＯR^{39}又は－Ｓ（Ｏ）$_{n2}R^{20}$を表し、ｎが２以上の整数を表すとき、各々のR^{29}は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよい上記〔１〕記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0008] 〔３〕

R^{19}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^6によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、R^6によって任意に置換された（C_3～C_6）シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキニル、フェニル、（R^7）$_p$によって置換されたフェニル、ナフチル又はＵ－１からＵ－２５の何れかの基を表し、

R^{24}は、水素原子、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_3～C_6）シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2

～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、C_3～C_6シクロアルケニル、－NH_2、C_1～C_6アルキルアミノ、ジ（C_1～C_6アルキル）アミノ、－NHC（O）R^8、フェニル、（R^{29}）$_r$によって置換されたフェニル又はU－1からU－26の何れかの基を表し、

R^7は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C_1～C_3アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6ハロシクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、C_3～C_6シクロアルケニル、C_1～C_6アルキルカルボニル、C_3～C_6シクロアルキルカルボニル、C_1～C_6ハロアルキルカルボニル、C_3～C_6ハロシクロアルキルカルボニル、C_1～C_6アルコキシカルボニル、C_1～C_6ハロアルコキシカルボニル、C_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_1～C_6ハロアルキルアミノカルボニル、ジ（C_1～C_6アルキルアミノ）カルボニル、－OR^{15}、－S（O）$_{m3}R^{20}$、C_1～C_6アルキルアミノスルホニル、ジ（C_1～C_6アルキル）アミノスルホニル、－NH_2、C_1～C_6アルキルアミノ、ジ（C_1～C_6アルキル）アミノ又はU－1からU－26の何れかの基を表し、

R^{27}は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、フェニル、（R^{28}）$_r$によって置換されたフェニル、－C（O）OR^{16}、－OR^{29}、－S（O）$_{r4}R^{30}$又はU－1からU－26の何れかの基を表す上記〔2〕記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0009] 〔4〕

R^{1a}は、水素原子、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、R^6によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、R^6によって任意に置換された（C_3～C_6）シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_3～C_6シクロアルケニル、－C（O）R^8、－OR^9、－S（O）$_{m1}R^{10}$、－N（R^{11}）R^{12}、－C（＝NR^{12b}）R^{8b}、フェニル、（R^7）$_p$によって置換されたフェニル、U－3、U－5a、U－6a、U－7、U－8、U－10a、U－11a、U－12a、又はU－13aを表し、

R^{1b}は、C_1～C_6アルキル又はR^6によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{2a}は、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、－S（O）$_m$$R^{20}$、ｎが２以上の整数を表すとき、各々の$R^{2a}$は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^3は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{4a}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{2f}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、フェニル、（R^{2d}）$_r$によって置換されたフェニル、Ｕ－１、Ｕ－２、Ｕ－７、Ｕ－１０ａ又はＵ－２６で示される複素環を表し、

R^{4b}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{4c}は、水素原子を表し、

R^{4d}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{5a}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{2f}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_2～C_6アルケニル又はフェニルを表し、

R^{5b}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{5c}は、C_1～C_6アルキルを表すか、或いはR^{5c}は、R^{4d}と－（CH_2）$_2$－又は－ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ－を形成することにより、R^{5c}が結合する窒素原子及びR^{4d}が結合する炭素原子と共に６員環を形成してもよく、

R^{2f}は、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、R^{2f}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル又は－ＯＲ^{1b}を表し、

R^{8b}は、水素原子を表し、

R^9は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{10}は、C_1～C_6アルキル、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル又はC_2～C_6アルキニルを表し、

R^{11}は、C_1～C_6アルキル、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキ

ニル、フェニルスルホニル、フェニル、（R^7）$_p$によって置換されたフェニル又はＵ－７を表し、

R^{12}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{11}はR^{12}と一緒になってC_4～C_5アルキレン鎖を形成することにより、R^{11}及びR^{12}が結合する窒素原子と共に５～６員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はＯ、Ｓ、Ｓ（Ｏ）又はＳ（Ｏ）$_2$を１個含んでもよく、

R^{11a}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{12a}は、水素原子を表し、

R^{13}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、－Ｃ（Ｏ）R^9又はフェニルを表し、

R^{14}は、C_1～C_6アルキル又はR^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{15}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{15b}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{20}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{27}は、ハロゲン原子、フェニル、（R^{28}）$_r$によって置換されたフェニル、－ＯＲ^{29}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{16}又は－Ｓ（Ｏ）$_{t4}R^{30}$を表し、

R^{28}は、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル又は－ＯＲ^{31}を表し、ｔ２、ｔ３、ｔ４、ｔ５又はｔ７が２以上の整数を表すとき、各々のR^{28}は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、更に２つのR^{28}が隣接する場合には、隣接する２つのR^{28}は一緒になって－ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ－を形成することにより、それぞれのR^{28}が結合する炭素原子と共に６員環を形成してもよく、

R^{29}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{30}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{31}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{34}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{34}は、ハロゲン原子、シアノ、C_3～C_6シクロアルキル、－C（O）R^8、－C（O）OR^{10}、－OR^{33}、－S（O）$_{n6}R^{33}$、フェニル、（R^7）$_p$によって置換されたフェニル、U－1、U－8又はU－22aを表す上記〔3〕記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0010] 〔5〕

Qは、Q－1で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W－1で示される芳香族複素環を表す上記〔4〕記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0011] 〔6〕

Xは、酸素原子を表し、

R^{31}は、水素原子、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、R^6によって任意に置換された（C_1～C_5）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、R^6によって任意に置換された（C_3～C_5）シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_3～C_6アルキニル、C_3～C_5シクロアルケニル、－C（O）R^8、－OR^9、－S（O）$_{n1}R^{10}$、－N（R^{11}）R^{12}、－C（＝NR^{26b}）R^{30}、フェニル、（R^7）$_p$によって置換されたフェニル、U－5a、U－6a、U－7、U－8、U－10a、U－11a、U－12a、又はU－13aを表し、

R^{29}は、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、－S（O）$_{n2}R^{29}$、nが2以上の整数を表すとき、各々のR^{29}は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^6は、ハロゲン原子、シアノ、C_3～C_5シクロアルキル、－C（O）R^8、－C（O）OR^{13}、－OR^{13}、－S（O）$_{n2}R^{14}$又は（R^7）$_p$によって置換されたフェニルを表し、

R^{30}は、ハロゲン原子、フェニル、－OR^{29}又は－S（O）$_{n2}R^{29}$を表す上記〔5〕記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0012] 〔7〕

R^{41}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキルを表し、

R^{27}は、ハロゲン原子、－ＯＲ^{29}を表す上記〔６〕記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0013] 〔８〕

Ｑは、Ｑ－３で示される芳香族複素環を表し、

Ｗは、Ｗ－１で示される芳香族複素環を表す上記〔４〕記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0014] 〔９〕

R^{1a}は、水素原子、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、R^6によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、R^6によって任意に置換された（C_3～C_6）シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキニル、－Ｃ（Ｏ）R^8、－Ｓ（Ｏ）$_{m1}R^{1c}$、－Ｎ（R^{11}）R^{12}、フェニル、（Ｒ^7）$_p$によって置換されたフェニル、Ｕ－３、Ｕ－５ａ、Ｕ－６ａ、Ｕ－８、Ｕ－１０ａ、又はＵ－１３ａを表し、

R^{2a}は、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキルを表し、ｎが２以上の整数を表すとき、各々のR^{2a}は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^6は、ハロゲン原子、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{15}、－ＯＲ^{13}、－Ｓ（Ｏ）$_{m2}R^{14}$又は（Ｒ^7）$_p$によって置換されたフェニルを表し、

Ｒ^{7}は、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル又は－ＯＲ^{15}を表し、

R^8は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{11}は、C_1～C_6アルキル、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキニル、フェニル又は（Ｒ^7）$_p$によって置換されたフェニルを表し、

R^{11}はR^{12}と一緒になってC_5アルキレン鎖を形成することにより、R^{11}及びR^{12}が結合する窒素原子と共に６員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はＯ、Ｓ、Ｓ（Ｏ）又はＳ（Ｏ）$_2$を１個含んでもよく、

R^{15}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{27}は、$(R^{26})_r$によって置換されたフェニル、$-OR^{23}$、$-C(O)OR^{19}$又は$-S(O)_mR^{30}$を表し、

R^{28}は、ハロゲン原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{34}は、ハロゲン原子、シアノ、C_3～C_6シクロアルキル、$-OR^{33}$、$-S(O)_mR^{33}$、フェニル、$(R^7)_p$によって置換されたフェニル、U－1又はU－8を表す上記〔8〕記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0015] 〔10〕

R^{29}は、C_1～C_6アルキル、R^{37}によって任意に置換された(C_1～C_6)アルキル又はC_2～C_5アルケニルを表し、

R^{27}は、$-OR^{29}$又は$-S(O)_pR^{31}$を表す上記〔9〕記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0016] 〔11〕

Xは、酸素原子を表す上記〔1〕～〔10〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0017] 〔12〕

Xは、硫黄原子を表す上記〔1〕～〔10〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0018] 〔13〕

R^3は、水素原子表す上記〔1〕～〔12〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0019] 〔14〕

R^3は、C_1～C_5アルキルを表す上記〔1〕～〔12〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0020] 〔15〕

R^{29}は、C_1～C_6ハロアルキルを表す上記〔1〕～〔14〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0021] 〔16〕

R^{21}は、ハロゲン原子を表す上記〔1〕～〔14〕のいずれかに記載の複素

環アミド化合物又はその塩。

[0022] 〔１７〕

R^{2a}は、－Ｓ（Ｏ）$_{n5}R^{30}$を表し、

R^{23}は、C_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔１４〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0023] 〔１８〕

R^{2a}は、トリフルオロメチルを表す上記〔１〕～〔１４〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0024] 〔１９〕

ｎは、１、２又は３の整数を表す上記〔１〕～〔１８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0025] 〔２０〕

ｎは、１の整数を表す上記〔１〕～〔１８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0026] 〔２１〕

Ｑは、Ｑ－２で示される芳香族複素環を表し、

Ｗは、Ｗ－１で示される芳香族複素環を表す上記〔１〕～〔２０〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0027] 〔２２〕

Ｑは、Ｑ－４で示される芳香族複素環を表し、

Ｗは、Ｗ－１で示される芳香族複素環を表す上記〔１〕～〔２０〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0028] 〔２３〕

Ｑは、Ｑ－５で示される芳香族複素環を表し、

Ｗは、Ｗ－１で示される芳香族複素環を表す上記〔１〕～〔２０〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0029] 〔２４〕

Ｑは、Ｑ－１で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W－２で示される芳香族複素環を表す上記〔１〕～〔２０〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0030] 〔２５〕

Qは、Q－２で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W－２で示される芳香族複素環を表す上記〔１〕～〔２０〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0031] 〔２６〕

Qは、Q－３で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W－２で示される芳香族複素環を表す上記〔１〕～〔２０〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0032] 〔２７〕

Qは、Q－４で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W－２で示される芳香族複素環を表す上記〔１〕～〔２０〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0033] 〔２８〕

Qは、Q－５で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W－２で示される芳香族複素環を表す上記〔１〕～〔２０〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0034] 〔２９〕

Qは、Q－１で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W－３で示される芳香族複素環を表す上記〔１〕～〔２０〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0035] 〔３０〕

Qは、Q－２で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W－３で示される芳香族複素環を表す上記〔１〕～〔２０〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0036] 〔３１〕

Qは、Q－３で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W－３で示される芳香族複素環を表す上記〔１〕～〔２０〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0037] 〔３２〕

Qは、Q－４で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W－３で示される芳香族複素環を表す上記〔１〕～〔２０〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0038] 〔３３〕

Qは、Q－５で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W－３で示される芳香族複素環を表す上記〔１〕～〔２０〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0039] 〔３４〕

R^{40}は、水素原子を表す上記〔１〕～〔３３〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0040] 〔３５〕

R^{40}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔３３〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0041] 〔３６〕

R^{40}は、C_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔３３〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0042] 〔３７〕

R^{40}は、C_1～C_3アルキルを表す上記〔１〕～〔３３〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0043] 〔３８〕

R^{40}は、メチルを表す上記〔１〕～〔３３〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0044] 〔３９〕

R^{40}は、エチルを表す上記〔１〕～〔３３〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0045] 〔４０〕

R^{1a}は、C_3～C_6シクロアルキルを表す上記〔１〕～〔３３〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0046] 〔４１〕

R^{1a}は、C_1～C_3ハロアルキルを表す上記〔１〕～〔３３〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0047] 〔４２〕

R^{2a}は、水素原子を表す上記〔１〕～〔４１〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0048] 〔４３〕

R^{2a}は、C_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔４１〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0049] 〔４４〕

R^{2a}は、C_1～C_3アルキルを表す上記〔１〕～〔４１〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0050] 〔４５〕

R^{2a}は、メチルを表す上記〔１〕～〔４１〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0051] 〔４６〕

R^{2a}は、エチルを表す上記〔１〕～〔４１〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0052] 〔４７〕

R^{2a}は、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{27}は、－OR^{29}又は－$S(O)_pR^{30}$を表し、

R^{29}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{30}は、C_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔４１〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0053] 〔４８〕

R^{5a}は、C_2～C_6アルケニルを表す上記〔１〕～〔４１〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0054] 〔４９〕

R^{3a}は、C_1～C_6アルキル、R^6によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、R^8によって任意に置換された（C_3～C_6）シクロアルキル、C_2～C_5アルケニル、－ＣＨＯ、－Ｓ（Ｏ）$_{m'}R^{10}$、－Ｎ（R^{11}）R^{12}、フェニル、（R^7）$_p$によって置換されたフェニル、Ｕ－３、Ｕ－５ａ、Ｕ－６ａ、Ｕ－７、Ｕ－８、Ｕ－１０ａ、Ｕ－１１ａ、Ｕ－１２ａ、又はＵ－１３ａを表し、

R^6は、ハロゲン原子、シアノ、C_3～C_5シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）OR^{16}、－OR^{17}、－Ｓ（Ｏ）$_{m2}R^{14}$、フェニル又は（R^7）$_r$によって置換されたフェニルを表し、

R^8は、C_1～C_5アルキルを表し、

R^{10}は、C_1～C_6アルキル、R^{16}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_5シクロアルキル又はC_2～C_6アルケニルを表し、

R^{11}は、C_1～C_6アルキル、R^{16}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_5シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、フェニル、（R^7）$_p$によって置換されたフェニル又はＵ－７を表し、

R^{12}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{11}はR^{12}と一緒になってC_4～C_5アルキレン鎖を形成することにより、R^{11}及びR^{12}が結合する窒素原子と共に５～６員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はＯ、Ｓ、Ｓ（Ｏ）又はＳ（Ｏ）$_2$を１個含んでもよく、

R^{13}は、水素原子、C_1～C_6アルキル又はR^{16}によって任意に置換された（C_1～C_5）アルキルを表し、

R^{14}は、C_1～C_6アルキル又はR^{16}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{15}は、水素原子、C_1～C_6アルキル又はR^{37}によって任意に置換された（C

～C_6）アルキルを表し、

R^{51}は、シアノ、C_3～C_6シクロアルキル、－C（O）R^5、－C（O）OR^{16}、－OR^{32}、－S（O）$_{m6}R^{33}$又はU－1を表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0055] 〔50〕

R^{31}は、C_1～C_6アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、－CHOを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0056] 〔51〕

R^{31}は、C_1～C_6アルキル、C_3～C_6シクロアルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0057] 〔52〕

R^{31}は、C_1～C_6アルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0058] 〔53〕

R^{31}は、C_3～C_6シクロアルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0059] 〔54〕

R^{31}は、R^5によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^6は、ハロゲン原子を表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0060] 〔55〕

R^{31}は、R^5によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^6は、シアノを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0061] 〔56〕

R^{31}は、R^6によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^6は、C_3～C_6シクロアルキルを表す上記〔1〕～〔48〕のいずれかに記

載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0062] 〔５７〕

R^{3a}は、R^{5}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{6}は、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{13}を表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0063] 〔５８〕

R^{3a}は、R^{5}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{6}は、－ＯＲ^{13}を表し、

R^{7}は、C_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0064] 〔５９〕

R^{3a}は、R^{5}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{6}は、－ＯＲ^{13}を表し、

R^{7}は、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{34}は、－ＯＲ^{33}を表し、

R^{33}は、C_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0065] 〔６０〕

R^{3a}は、R^{5}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{6}は、－Ｓ（Ｏ）$_{r2}$Ｒ^{4}を表し、

Ｒ^{4}は、C_1～C_6アルキル又はR^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{34}は、ハロゲン原子又は－ＯＲ^{33}を表し、

R^{33}は、C_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0066] 〔６１〕

R^{3a}は、R^{5}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{6}は、－Ｓ（Ｏ）$_{r2}$Ｒ^{4}を表し、

R^5は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{31}は、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{32}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{34}は、シアノ、C_3～C_6シクロアルキル、－C（O）R^5、－C（O）OR^{16}、－OR^{32}又は－S（O）$_{m6}R^{33}$を表し、

R^{33}は、C_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0067] 〔６２〕

R^{31}は、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^6は、－S（O）$_{n2}R^{14}$を表し、

R^{14}は、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル又はC_2～C_6ハロアルキニルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0068] 〔６３〕

R^{31}は、R^{34}によって任意に置換された（C_3～C_6）シクロアルキル表し、

R^6は、ハロゲン原子を表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0069] 〔６４〕

R^{31}は、R^{34}によって任意に置換された（C_3～C_6）シクロアルキル表し、

R^6は、－OR^{13}を表し、

R^{13}は、C_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0070] 〔６５〕

R^{31}は、－S（O）$_{m1}R^{18}$を表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0071] 〔６６〕

R^{31}は、－S（O）$_{m1}R^{18}$を表し、

R^{18}は、C_1～C_6アルキル、R^{34}によって任意に置換された（C_3～C_6）アル

キル、C_3～C_6シクロアルキル又はC_2～C_6アルケニルを表し、

R^{51}は、ハロゲン原子、シアノ、C_3～C_6シクロアルキル、－C（O）R^5、－C（O）OR^6、－OR^{33}を表し、

R^5は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^6は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{52}は、C_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0072] 〔６７〕

R^{31}は、－S（O）$_m$-R^{10}を表し、

R^{32}は、C_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0073] 〔６８〕

R^{31}は、－S（O）$_m$-R^{10}を表し、

R^{32}は、C_3～C_6シクロアルキルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0074] 〔６９〕

R^{31}は、－S（O）$_m$-R^{10}を表し、

R^{32}は、C_2～C_6アルケニルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0075] 〔７０〕

R^{31}は、－S（O）$_m$-R^{10}を表し、

R^{32}は、C_2～C_6アルキニルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0076] 〔７１〕

R^{31}は、－S（O）$_m$-R^{10}を表し、

R^{32}は、R^{34}によって任意に置換された（C_3～C_6）アルキルを表し、

R^{34}は、ハロゲン原子を表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0077] 〔７２〕

R^{1a}は、$-S(O)_{m}R^{10}$を表し、

R^{12}は、R^{24}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{34}は、シアノを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0078] 〔７３〕

R^{1a}は、$-S(O)_{m}R^{10}$を表し、

R^{12}は、R^{24}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{34}は、C_2～C_6シクロアルキルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0079] 〔７４〕

R^{1a}は、$-S(O)_{m}R^{10}$を表し、

R^{12}は、R^{24}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{34}は、$-C(O)R^{8}$、$-C(O)OR^{16}$を表し、

R^{8}は、C_1～C_5アルキルを表し、

R^{16}は、C_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0080] 〔７５〕

R^{1a}は、$-S(O)_{m}R^{10}$を表し、

R^{12}は、R^{24}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{34}は、$-OR^{33}$を表し、

R^{33}は、C_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0081] 〔７６〕

R^{1a}は、$-S(O)_{m}R^{10}$を表し、

R^{12}は、R^{24}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{34}は、$-S(O)_{mb}R^{33}$を表し、

R^{33}は、C_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の

複素環アミド化合物又はその塩。

[0082] 〔７７〕

R^{3a}は、－Ｎ（R^{11}）R^{12}を表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0083] 〔７８〕

R^{3a}は、－Ｎ（R^{11}）R^{12}を表し、

R^{11}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{12}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0084] 〔７９〕

R^{3a}は、－Ｎ（R^{11}）R^{12}を表し、

R^{11}は、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_2～C_5アルケニルを表し、

R^{12}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{34}は、ハロゲン原子、シアノ、－Ｓ（Ｏ）$_{m6}R^{33}$を表し、

R^{33}は、C_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0085] 〔８０〕

R^{3a}は、－Ｎ（R^{11}）R^{12}を表し、

R^{11}は、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{12}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{34}は、－ＯＲ^{33}を表し、

R^{33}は、C_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0086] 〔８１〕

R^{3a}は、－Ｎ（R^{11}）R^{12}を表し、

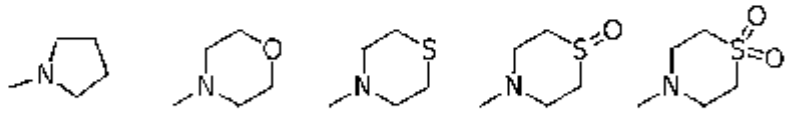
R^{11}はR^{12}と一緒になってC_4～C_7アルキレン鎖を形成することにより、R^{11}及びR^{12}が結合する窒素原子と共に５～６員環を形成し、このときこのアルキ

レン鎖はO、S、S（O）又はS（O）$_2$を１個含んでもよい上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0087] 〔８２〕

R^{13}は、以下の構造式で表される置換基を表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

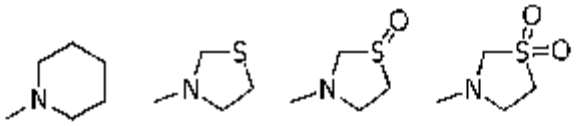
[化5]



[0088] 〔８３〕

R^{13}は、以下の構造式で表される置換基を表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[化6]



[0089] 〔８４〕

R^{11}は、フェニル又は（R^{7}）$_p$によって置換されたフェニルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0090] 〔８５〕

R^{11}は、R^{6}によって任意に置換された（C～C$_6$）アルキルを表し、

R^{6}は、フェニル又は（R^{7}）$_p$によって置換されたフェニルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0091] 〔８６〕

R^{11}は、R^{6}によって任意に置換された（C～C$_6$）アルキルを表し、

R^{6}は、－OR^{13}を表し、

R^{13}は、R^{34}によって任意に置換された（C～C$_6$）アルキルを表し、

R^{34}は、フェニル又は（R^{7}）$_p$によって置換されたフェニルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0092] 〔８７〕

R^{13}は、R^{5}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{6}は、－Ｓ（Ｏ）$_{n2}R^{14}$を表し、

R^{14}は、R^{24}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{24}は、フェニル又は（R^{7}）$_{p}$によって置換されたフェニルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0093] 〔８８〕

R^{13}は、－Ｓ（Ｏ）$_{n1}R^{18}$を表し、

R^{12}は、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{34}は、フェニル又は（R^{7}）$_{p}$によって置換されたフェニルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0094] 〔８９〕

R^{13}は、－Ｎ（R^{11}）R^{12}を表し、

R^{11}は、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{12}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{34}は、フェニル、（R^{7}）$_{p}$によって置換されたフェニルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0095] 〔９０〕

R^{13}は、－Ｎ（R^{11}）R^{12}を表し、

R^{11}は、フェニル、（R^{7}）$_{p}$によって置換されたフェニルを表し、

R^{12}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0096] 〔９１〕

R^{7}は、ハロゲン原子、C_1～C_3アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_3）アルキル又は－ＯＲ^{15}を表し、

R^{15}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{27}は、ハロゲン原子、－ＯＲ^{29}又は－Ｓ（Ｏ）$_{n2}R^{38}$を表し、

R^{29}及びR^{38}は、各々独立してC_1～C_6アルキルを表す上記〔８４〕～〔９０

〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0097] 〔９２〕

R^7は、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル又は－ＯＲ^{15}を表し、

R^{15}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{27}は、ハロゲン原子を表す上記〔８４〕～〔９０〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0098] 〔９３〕

R^{39}は、Ｕ－１乃至Ｕ－２５のいずれかの複素環を表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0099] 〔９４〕

R^{39}は、Ｕ－３、Ｕ－５ａ、Ｕ－６ａ、Ｕ－７、Ｕ－８、Ｕ－１０ａ、Ｕ－１１ａ、Ｕ－１２ａ、又はＵ－１３ａを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0100] 〔９５〕

R^{39}は、－Ｎ（R^{41}）R^{42}を表し、

R^{41}は、Ｕ－７、Ｕ－８、Ｕ－９又はＵ－１４乃至Ｕ－１９を表し、

R^{42}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0101] 〔９６〕

R^{39}は、－Ｎ（R^{41}）R^{42}を表し、

R^{41}は、Ｕ－７を表し、

R^{42}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0102] 〔９７〕

R^{39}は、－Ｓ（Ｏ）$_m$$R^{40}$を表し、

R^{40}は、R^{44}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{44}は、Ｕ－７、Ｕ－８、Ｕ－９又はＵ－１４乃至Ｕ－１９を表す上記〔１

〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0103] 〔９８〕

R^{3a}は、－Ｓ（Ｏ）$_{n}$$R^{30}$を表し、

R^{32}は、R^{34}によって任意に置換された（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキルを表し、

R^{34}は、Ｕ－１、Ｕ－３又はＵ－２０乃至Ｕ－２５を表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0104] 〔９９〕

R^{3a}は、－Ｓ（Ｏ）$_{n}$$R^{30}$を表し、

R^{32}は、R^{34}によって任意に置換された（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキルを表し、

R^{34}は、Ｕ－１、Ｕ－３又はＵ－２２ａを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0105] 〔１００〕

R^{3a}は、－Ｎ（R^{31}）R^{32}を表し、

R^{31}は、R^{34}によって任意に置換された（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキルを表し、

R^{32}は、水素原子又はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルを表し、

R^{34}は、Ｕ－７、Ｕ－８、Ｕ－９又はＵ－１４乃至Ｕ－１９を表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0106] 〔１０１〕

R^{3a}は、－Ｎ（R^{31}）R^{32}を表し、

R^{31}は、R^{34}によって任意に置換された（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキルを表し、

R^{32}は、水素原子又はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルを表し、

R^{34}は、Ｕ－１、Ｕ－３又はＵ－２０乃至Ｕ－２５を表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0107] 〔１０２〕

R^{3a}は、－Ｎ（R^{31}）R^{32}を表し、

R^{31}は、R^{34}によって任意に置換された（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキルを表し、

R^{32}は、水素原子又はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルを表し、

R^{34}は、Ｕ－１、Ｕ－３又はＵ－２２ａを表す上記〔１〕～〔４８〕のいず

れかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0108] 〔１０３〕

R^{3a}は、R^{5}によって任意に置換された（C_{1}～C_{6}）アルキルを表し、

R^{6}は、－OR^{12}を表し、

R^{12}は、R^{24}によって任意に置換された（C_{1}～C_{6}）アルキルを表し、

R^{24}は、Ｕ－７、Ｕ－８、Ｕ－９又はＵ－１４乃至Ｕ－１９を表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0109] 〔１０４〕

R^{3a}は、R^{5}によって任意に置換された（C_{1}～C_{6}）アルキルを表し、

R^{6}は、－OR^{12}を表し、

R^{12}は、R^{34}によって任意に置換された（C_{1}～C_{6}）アルキルを表し、

R^{34}は、Ｕ－１、Ｕ－３又はＵ－２０乃至Ｕ－２５を表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0110] 〔１０５〕

R^{3a}は、R^{5}によって任意に置換された（C_{1}～C_{6}）アルキルを表し、

R^{6}は、－OR^{12}を表し、

R^{12}は、R^{34}によって任意に置換された（C_{1}～C_{6}）アルキルを表し、

R^{34}は、Ｕ－１、Ｕ－３又はＵ－２２ａを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0111] 〔１０６〕

R^{3a}は、R^{5}によって任意に置換された（C_{1}～C_{6}）アルキルを表し、

R^{6}は、－$S(O)_{r2}R^{14}$を表し、

R^{14}は、R^{34}によって任意に置換された（C_{1}～C_{6}）アルキルを表し、

R^{34}は、Ｕ－７、Ｕ－８、Ｕ－９又はＵ－１４乃至Ｕ－１９を表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0112] 〔１０７〕

R^{3b}は、R^{5}によって任意に置換された（C_{1}～C_{6}）アルキルを表し、

R^{6}は、－$S(O)_{r2}R^{14}$を表し、

R^{41}は、R^{21}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{21}は、Ｕ－１、Ｕ－３又はＵ－２０乃至Ｕ－２５を表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0113] 〔１０８〕

R^{43}は、R^{6}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{6}は、－Ｓ（Ｏ）$_{t2}R^{41}$を表し、

R^{41}は、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{34}は、Ｕ－１、Ｕ－３又はＵ－２２ａを表す上記〔１〕～〔４８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0114] 〔１０９〕

ｔ１、ｔ２、ｔ３、ｔ４、ｔ５、ｔ７、ｔ８及びｔ９は、各々独立して０の整数を表す上記〔９３〕～〔１０８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0115] 〔１１０〕

R^{23}は、ハロゲン原子、シアノ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_5シクロアルキル、（C_1～C_6アルコキシ）C_1～C_6アルキル、－OR^{31}又は－Ｓ（Ｏ）$_{m4}R^{30}$を表す上記〔９３〕～〔１０８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0116] 〔１１１〕

R^{23}は、ハロゲン原子を表す上記〔９３〕～〔１０８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0117] 〔１１２〕

R^{23}は、C_1～C_6アルキルを表す上記〔９３〕～〔１０８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0118] 〔１１３〕

R^{23}は、C_1～C_6アルコキシを表す上記〔９３〕～〔１０８〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[0119] 〔１１４〕

上記〔１〕～〔１１３〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物及びその塩から選ばれる１種又は２種以上を有効成分として含有する農薬。

[0120] 〔１１５〕

上記〔１〕～〔１１３〕のいずれかに記載の複素環アミド化合物及びその塩から選ばれる１種又は２種以上を有効成分として含有する除草剤。

発明の効果

[0121] 本発明化合物は、各種雑草に対して優れた除草活性を有し、且つ、対象となる作物に対しては高い安全性を有する。さらに、ホ乳動物、魚類及び益虫等の非標的生物に対してほとんど悪影響を及ぼさず、低残留性で環境に対する負荷も軽い。

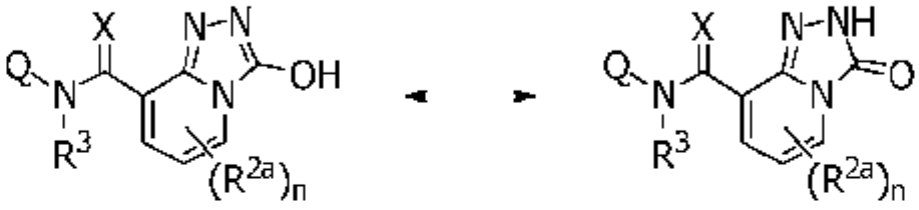
従って、本発明は水田、畑地及び果樹園等の農園芸分野において有用な除草剤を提供することができる。

発明を実施するための形態

[0122] 本発明に包含される化合物には、置換基の種類によってはＥ－体及びＺ－体の幾何異性体が存在する場合があるが、本発明はこれらＥ－体、Ｚ－体又はＥ－体及びＺ－体を任意の割合で含む混合物を包含するものである。また、本発明に包含される化合物は、１個又は２個以上の不斉炭素原子の存在に起因する光学活性体が存在するが、本発明は全ての光学活性体又はラセミ体を包含する。

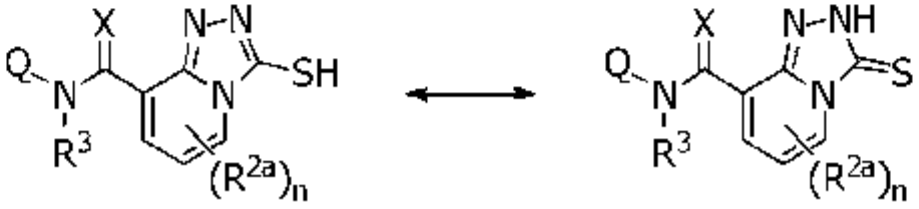
[0123] また、本発明に包含される化合物には、置換基の種類によって互変異性体が存在する場合があるが、本発明は全ての互変異性体又は任意の割合で含む互変異性体の混合物を包含するものである。例えば一般式（１）[式中、Ｗは Ｗ－１を表し、R^{3}はヒドロキシ基を表し、ｎ、Ｑ、R^{2a}、R^{2}、Ｘは前記と同じ意味を表す。]で表される化合物の場合、次のような互変異性体を包含するものである。

[化7]



[0124] 同様に、例えば一般式（１）[式中、WはW－１を表し、R[3a]は－ＳＨ基を表し、ｎ、Q、R[2a]、R[3]、Xは前記と同じ意味を表す。]で表される化合物の場合、次のような互変異性体を包含するものである。

[化8]



[0125] 本発明に包含される化合物のうちで、常法に従って酸付加塩にすることができるものは、例えば、フッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸、沃化水素酸等のハロゲン化水素酸の塩、硝酸、硫酸、燐酸、塩素酸、過塩素酸等の無機酸の塩、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等のスルホン酸の塩、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、フマール酸、酒石酸、修酸、マレイン酸、リンゴ酸、コハク酸、安息香酸、マンデル酸、アスコルビン酸、乳酸、グルコン酸、クエン酸等のカルボン酸の塩又はグルタミン酸、アスパラギン酸等のアミノ酸の塩とすることができる。

[0126] 或いは、本発明に包含される化合物のうちで、常法に従って金属塩にすることができるものは、例えば、リチウム、ナトリウム、カリウムといったアルカリ金属の塩、カルシウム、バリウム、マグネシウムといったアルカリ土類金属の塩又はアルミニウムの塩とすることができる。

次に、本明細書において示した各置換基の具体例を以下に示す。ここで、ｎ－はノルマル、ｉ－はイソ、ｓ－はセカンダリー及びｔｅｒｔ－はターシ

ャリーを各々意味し、Ｐｈはフェニルを意味する。

[0127] 本明細書におけるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子が挙げられる。尚、本明細書中「ハロ」の表記もこれらのハロゲン原子を表す。

本明細書におけるC_a～C_bアルキルの表記は、炭素原子数がａ～ｂ個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、例えばメチル基、エチル基、ｎ－プロピル基、ｉ－プロピル基、ｎ－ブチル基、ｉ－ブチル基、ｓ－ブチル基、ｔｅｒｔ－ブチル基、ｎ－ペンチル基、１，１－ジメチルプロピル基、ｎ－ヘキシル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0128] 本明細書におけるC_a～C_bシクロアルキルの表記は、炭素原子数がａ～ｂ個よりなる環状の炭化水素基を表し、３員環から６員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていてもよい。例えばシクロプロピル基、１－メチルシクロプロピル基、２－メチルシクロプロピル基、２，２－ジメチルシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0129] 本明細書におけるC_a～C_bハロシクロアルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数がａ～ｂ個よりなる環状の炭化水素基を表し、３員環から１０員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていてもよく、ハロゲン原子による置換は環構造部分であっても、側鎖部分であっても、或いはそれらの両方であってもよく、さらに、２個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっていてもよい。例えば２，２－ジフルオロシクロプロピル基、２，２－ジクロロシクロプロピル基、２，２－ジブロモシクロプロピル基、２，２－ジフルオロ－１－メチル

シクロプロピル基、２，２-ジクロロ-１-メチルシクロプロピル基、２，２-ジブロモ-１-メチルシクロプロピル基、２，２，３，３-テトラフルオロシクロブチル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0130] 本明細書におけるC_a～C_bアルケニルの表記は、炭素原子数がａ～ｂ個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に１個又は２個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、例えばビニル基、１－プロペニル基、２－プロペニル基、１－メチルエテニル基、２－ブテニル基、２－メチル－２－プロペニル基、３－メチル－２－ブテニル基、１，１－ジメチル－２－プロペニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0131] 本明細書におけるC_a～C_bハロアルケニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数がａ～ｂ個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に１個又は２個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表す。このとき、２個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっていてもよい。例えば２，２－ジクロロビニル基、２－フルオロ－２－プロペニル基、２－クロロ－２－プロペニル基、３－クロロ－２－プロペニル基、２－ブロモ－２－プロペニル基、３，３－ジフルオロ－２－プロペニル基、２，３－ジクロロ－２－プロペニル基、３，３－ジクロロ－２－プロペニル基、２，３，３－トリフルオロ－２－プロペニル基、２，３，３－トリクロロ－２－プロペニル基、１－（トリフルオロメチル）エテニル基、４，４－ジフルオロ－３－ブテニル基、３，４，４－トリフルオロ－３－ブテニル基、３－クロロ－４，４，４－トリフルオロ－２－ブテニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0132] 本明細書におけるC_a～C_bシクロアルケニルの表記は、炭素原子数がａ～ｂ個よりなる環状の、且つ１個又は２個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、３員環から６員環までの単環又は複合環構造を形成することが

出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていてもよく、さらに、二重結合はｅｎｄｏ－又はｅｘｏ－のどちらの形式であってもよい。例えば１－シクロペンテン－１－イル基、２－シクロペンテン－１－イル基、１－シクロヘキセン－１－イル基、２－シクロヘキセン－１－イル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0133] 本明細書におけるC_a～C_bアルキニルの表記は、炭素原子数がａ～ｂ個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に１個又は２個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、例えばエチニル基、１－プロピニル基、２－プロピニル基、１－ブチニル基、２－ブチニル基、３－ブチニル基、１，１－ジメチル－２－プロピニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0134] 本明細書におけるC_a～C_bハロアルキニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数がａ～ｂ個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に１個又は２個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素基を表す。このとき、２個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっていてもよい。例えば２－クロロエチニル基、２－ブロモエチニル基、２－ヨードエチニル基、３－クロロ－２－プロピニル基、３－ブロモ－２－プロピニル基、３－ヨード－２－プロピニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0135] 本明細書におけるC_a～C_bハロアルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数がａ～ｂ個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、このとき、２個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっていてもよい。例えばフルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、ヨードメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、トリクロ

ロメチル基、ブロモジフルオロメチル基、２－フルオロエチル基、２－クロロエチル基、２－ブロモエチル基、２，２－ジフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロエチル基、２－クロロ－２，２－ジフルオロエチル基、２，２，２－トリクロロエチル基、１，１，２，２－テトラフルオロエチル基、２－クロロ－１，１，２－トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、３，３，３－トリフルオロプロピル基、２，２，３，３，３－ペンタフルオロプロピル基、１，１，２，３，３，３－ヘキサフルオロプロピル基、ヘプタフルオロプロピル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（トリフルオロメチル）エチル基、１，２，２，２－テトラフルオロ－１－（トリフルオロメチル）エチル基、２，２，３，３，４，４，４－ヘプタフルオロブチル基、ノナフルオロブチル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0136] 本明細書におけるC_a～C_bアルコキシの表記は、炭素原子数がａ～ｂ個よりなる前記の意味であるアルキル－Ｏ－基を表し、例えばメトキシ基、エトキシ基、ｎ－プロピルオキシ基、ｉ－プロピルオキシ基、ｎ－ブチルオキシ基、ｉ－ブチルオキシ基、ｓ－ブチルオキシ基、ｔｅｒｔ－ブチルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0137] 本明細書におけるC_a～C_bアルキルチオの表記は、炭素原子数がａ～ｂ個よりなる前記の意味であるアルキル－Ｓ－基を表し、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、ｎ－プロピルチオ基、ｉ－プロピルチオ基、ｎ－ブチルチオ基、ｉ－ブチルチオ基、ｓ－ブチルチオ基、ｔｅｒｔ－ブチルチオ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0138] 本明細書におけるC_a～C_bアルキルカルボニルの表記は、炭素原子数がａ～ｂ個よりなる前記の意味であるアルキル－Ｃ（Ｏ）－基を表し、例えばアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、バレリル基、イソバレリル基、２－メチルブタノイル基、ピバロイル基、ヘキサノイル基、ヘプタノイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0139] 本明細書におけるC_a～C_bハロアルキルカルボニルの表記は、炭素原子数がａ～ｂ個よりなる前記の意味であるハロアルキル－Ｃ（Ｏ）－基を表し、例えばフルオロアセチル基、クロロアセチル基、ジフルオロアセチル基、ジクロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、クロロジフルオロアセチル基、ブロモジフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、ペンタフルオロプロピオニル基、ヘプタフルオロブタノイル基、３－クロロ－２，２－ジメチルプロパノイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0140] 本明細書におけるC_a～C_bシクロアルキルカルボニルの表記は、炭素原子数がａ～ｂ個よりなる前記の意味であるシクロアルキル－Ｃ（Ｏ）－基を表し、例えばシクロプロピルカルボニル基、２－メチルシクロプロピルカルボニル基、シクロブチルカルボニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0141] 本明細書におけるC_a～C_bハロシクロアルキルカルボニルの表記は、炭素原子数がａ～ｂ個よりなる前記の意味であるハロシクロアルキル－Ｃ（Ｏ）－基を表し、例えば２，２－ジクロロシクロプロピルカルボニル基、２，２－ジクロロ－１－メチルシクロプロピルカルボニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0142] 本明細書におけるC_a～C_bアルコキシカルボニルの表記は、炭素原子数がａ～ｂ個よりなる前記の意味であるアルキル－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－基を表し、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、ｎ－プロピルオキシカルボニル基、ｉ－プロピルオキシカルボニル基、ｎ－ブトキシカルボニル基、ｉ－ブトキシカルボニル基、ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0143] 本明細書におけるC_a～C_bハロアルコキシカルボニルの表記は、炭素原子数がａ～ｂ個よりなる前記の意味であるハロアルキル－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－基を表し、例えばクロロメトキシカルボニル基、２－クロロエトキシカルボニル基、２，２－ジフルオロエトキシカルボニル基、２，２，２－トリフルオロエ

トキシカルボニル基、２，２，２－トリクロロエトキシカルボニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0144] 本明細書におけるC_a～C_bアルキルアミノカルボニルの表記は、水素原子の一方が炭素原子数ａ～ｂ個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたカルバモイル基を表し、例えばメチルカルバモイル基、エチルカルバモイル基、ｎ－プロピルカルバモイル基、ｉ－プロピルカルバモイル基、ｎ－ブチルカルバモイル基、ｉ－ブチルカルバモイル基、ｓ－ブチルカルバモイル基、ｔｅｒｔ－ブチルカルバモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0145] 本明細書におけるC_a～C_bハロアルキルアミノカルボニルの表記は、水素原子の一方が炭素原子数ａ～ｂ個よりなる前記の意味であるハロアルキル基によって置換されたカルバモイル基を表し、例えば２－フルオロエチルカルバモイル基、２－クロロエチルカルバモイル基、２，２－ジフルオロエチルカルバモイル基、２，２，２－トリフルオロエチルカルバモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0146] 本明細書におけるジ（C_a～C_bアルキル）アミノカルボニルの表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも又は互いに相異なっていてもよい炭素原子数がａ～ｂ個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたカルバモイル基を表し、例えばＮ，Ｎ－ジメチルカルバモイル基、Ｎ－エチル－Ｎ－メチルカルバモイル基、Ｎ，Ｎ－ジエチルカルバモイル基、Ｎ，Ｎ－ジ（ｎ－プロピル）カルバモイル基、Ｎ，Ｎ－ジ（ｎ－ブチル）カルバモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0147] 本明細書におけるC_a～C_bアルキルアミノスルホニルの表記は、水素原子の一方が炭素原子数がａ～ｂ個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたスルファモイル基を表し、例えばメチルスルファモイル基、エチルスルファモイル基、ｎ－プロピルスルファモイル基、ｉ－プロピルスルファモイル基、ｎ－ブチルスルファモイル基、ｉ－ブチルスルファモイル基、

ｓ－ブチルスルファモイル基、ｔｅｒｔ－ブチルスルファモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0148] 本明細書におけるジ（C_a～C_bアルキル）アミノスルホニルの表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも又は互いに相異なっていてもよい炭素原子数がａ～ｂ個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたスルファモイル基を表し、例えばＮ，Ｎ－ジメチルスルファモイル基、Ｎ－エチル－Ｎ－メチルスルファモイル基、Ｎ，Ｎ－ジエチルスルファモイル基、Ｎ，Ｎ－ジ（ｎ－プロピル）スルファモイル基、Ｎ，Ｎ－ジ（ｎ－ブチル）スルファモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0149] 本明細書におけるC_a～C_bアルキルアミノの表記は、水素原子の一方が炭素原子数がａ～ｂ個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたアミノ基を表し、例えばメチルアミノ基、エチルアミノ基、ｎ－プロピルアミノ基、ｉ－プロピルアミノ基、ｎ－ブチルアミノ基、ｉ－ブチルアミノ基、ｔｅｒｔ－ブチルアミノ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0150] 本明細書におけるジ（C_a～C_bアルキル）アミノの表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも又は互いに相異なっていてもよい炭素原子数がａ～ｂ個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたアミノ基を表し、例えばジメチルアミノ基、エチル（メチル）アミノ基、ジエチルアミノ基、ｎ－プロピル（メチル）アミノ基、ｉ－プロピル（メチル）アミノ基、ジ（ｎ－プロピル）アミノ基、ジ（ｎ－ブチル）アミノ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0151] 本明細書におけるR^{61}によって任意に置換された（C_a～C_b）アルキル、R^{62}によって任意に置換された（C_a～C_b）アルキル、R^{63}によって任意に置換された（C_a～C_b）アルキル、R^{65}によって任意に置換された（C_a～C_b）アルキル又はR^{66}によって任意に置換された（C_a～C_b）アルキル等の表記は、任意のR^{61}、R^{62}、R^{63}、R^{65}又はR^{66}によって、炭素原子に結合した水素原子が任意

に置換された炭素原子数がａ～ｂ個よりなる前記の意味であるアルキル基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。このとき、それぞれの（C_g～C_j）アルキル基上の置換基R^6、R^{27}、R^{31}、R^{33}又はR^{36}が２個以上存在するとき、それぞれのR^6、R^{27}、R^{31}、R^{33}又はR^{36}は互いに同一でも異なってもよい。

[0152] 本明細書におけるR^6によって任意に置換された（C_a～C_b）シクロアルキル又はR^{27}によって任意に置換された（C_a～C_b）シクロアルキル等の表記は、任意のR^6又はR^{27}によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数がａ～ｂ個よりなる前記の意味であるシクロアルキル基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。このとき、それぞれの（C_g～C_b）シクロアルキル基上の置換基R^6又はR^{27}が２個以上存在するとき、それぞれのR^6又はR^{27}は互いに同一でも異なってもよく、さらに置換位置は環構造部分であっても、側鎖部分であっても、或いはそれらの両方にあってもよい。

[0153] 本明細書における「R^{11}はR^{12}と一緒になってC_2～C_8アルキレン鎖を形成することにより、R^{11}及びR^{12}が結合する窒素原子と共に３～７員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はＯ、Ｓ、Ｓ（Ｏ）、Ｓ（Ｏ）$_2$又はＮ（R^{33}）を１個含んでもよく、且つオキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく」、「R^{11a}はR^{12a}と一緒になってC_2～C_8アルキレン鎖を形成することにより、R^{11a}及びR^{12a}が結合する窒素原子と共に３～７員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はＯ、Ｓ、Ｓ（Ｏ）、Ｓ（Ｏ）$_2$又はＮ（R^{33}）を１個含んでもよく、且つオキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく」及び「R^{21}はR^{22}と一緒になってC_2～C_8アルキレン鎖を形成することにより、R^{21}及びR^{22}が結合する窒素原子と共に３～７員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はＯ、Ｓ、Ｓ（Ｏ）、Ｓ（Ｏ）$_2$又はＮ（R^{39}）を１個含んでもよく、且つオキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく」の表記の具体例としては、例えばアジリジン、アゼチジン、アゼチジン－２－オ

ン、ピロリジン、ピロリジン－２－オン、オキサゾリジン、オキサゾリジン－２－オン、オキサゾリジン－２－チオン、チアゾリジン、チアゾリジン－２－オン、チアゾリジン－２－チオン、イミダゾリジン、イミダゾリジン－２－オン、イミダゾリジン－２－チオン、ピペリジン、ピペリジン－２－オン、ピペリジン－２－チオン、２Ｈ－３，４，５，６－テトラヒドロ－１，３－オキサジン－２－オン、２Ｈ－３，４，５，６－テトラヒドロ－１，３－オキサジン－２－チオン、モルホリン、２Ｈ－３，４，５，６－テトラヒドロ－１，３－チアジン－２－オン、２Ｈ－３，４，５，６－テトラヒドロ－１，３－チアジン－２－チオン、チオモルホリン、チオモルホリン－１－オキシド、チオモルホリン－１，１－ジオキシド、ペルヒドロピリミジン－２－オン、ピペラジン、ホモピペリジン、ホモピペリジン－２－オン、ヘプタメチレンイミン等が挙げられ、各々の指定の原子数の範囲で選択される。

[0154] 本明細書における（C_a～C_bアルコキシ）C_d～C_eアルキル又は（C_a～C_bアルキルチオ）C_d～C_eアルキル等の表記は、それぞれ前記の意味である任意のC_a～C_bアルコキシ基又はC_a～C_bアルキルチオ基によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数がｄ～ｅ個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0155] 本明細書における「５－６員芳香族複素環」とは、環を構成する原子数が５乃至６個であり、環を構成する原子中に１乃至５個のヘテロ原子（該ヘテロ原子は、窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を意味する。）を含有する単環の芳香族複素環であるものを意味し、具体例としては、例えばピロール、ピラゾール、イミダゾール、トリアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピリダジン、ピリミジン、ピラジン、トリアジン、フラン、チオフェン、チアゾール、イソチアゾール、オキサゾール、イソキサゾール、オキサジアゾール、チアジアゾール等が挙げられる。

また、この「５－６員芳香族複素環」がＣ＝Ｎ二重結合を有する場合はその窒素原子はＮ－オキシドであってもよい。

[0156] 本明細書における「５－６員ヘテロアリール」とは、前記定義「５－６員

芳香族複素環」から任意の位置の水素原子を１個取り除いた１価の置換基を意味する。なお、それらの結合位置は特に限定されず、所望の位置で結合していてよい。

[0157] 本明細書における「３－７員非芳香族複素環」とは、

１）環を構成する原子数が３乃至７個であり、

２）環を構成する原子中に１乃至３個のヘテロ原子（該ヘテロ原子は、窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を意味する。）を含有し、

３）環中にカルボニル基、チオカルボニル基、二重結合又は三重結合を含んでいてもよく、

４）環を構成する原子中に硫黄原子が含まれる場合、その硫黄原子はスルフィニル基又はスルホニル基であってもよい、

単環の非芳香族性の複素環を意味し、具体例としては、例えばアゼチジン、ピロリジン、ピロリジノン、オキサゾリジン、イソキサゾリジン、チアゾリジン、イソチアゾリジン、ピペラジン、ピペラジノン、ピペリジン、ピペリジノン、モルホリン、チオモルホリン、アゼピン、ジアゼピン、オキセタン、テトラヒドロフラン、１，３－ジオキソラン、テトラヒドロピラン、１，４－ジオキサン、オキセパン、ホモモルホリン等が挙げられる。

[0158] 本明細書における「３－７員ヘテロシクリル」とは、前記定義「３－７員非芳香族複素環」から任意の位置の水素原子を１個取り除いた１価の置換基を意味する。なお、それらの結合位置は特に限定されず、所望の位置で結合していてよい。

[0159] 本明細書における「R^{23}及びR^{23a}によって任意に置換された５－６員ヘテロアリール」とは、「５－６員ヘテロアリール」の環を構成する炭素原子上の水素原子が、存在する水素の数の範囲で任意のR^{23}によって炭素原子上で任意に置換された「５－６員ヘテロアリール」を表し、このとき、「５－６員ヘテロアリール」の環を構成する原子に窒素が存在し、かつその窒素原子がＮＨ構造を取りうる場合は、その窒素原子上の水素原子が、存在する水素の数の範囲で任意のR^{23a}によって窒素原子上で任意に置換されてもよい「５－６員

ヘテロアリール」を表す。このとき、それぞれの「５－６員ヘテロアリール」の環を構成する炭素原子上の置換基R^{23}及び環を構成するＮＨ構造を取りうる窒素原子に置換される置換基R^{23a}がそれぞれ独立して２個以上存在するとき、それぞれのR^{23}及びR^{23a}は互いに同一でも異なってもよく、更に２つのR^{23}が隣接する場合には、隣接する２つのR^{23}は一緒になって－ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ－を形成することにより、それぞれのR^{23}が結合する炭素原子と共に６員環を形成してもよい。

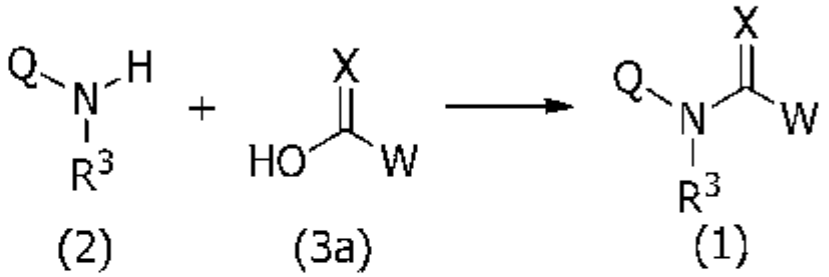
[0160] 本明細書における「R^{23}及びR^{23a}によって任意に置換された３－７員ヘテロシクリル」とは、「３－７員ヘテロシクリル」の環を構成する炭素原子上の水素原子が、存在する水素の数の範囲で任意のR^{23}によって炭素原子上で任意に置換された「３－７員ヘテロシクリル」を表し、このとき、「３－７員ヘテロシクリル」の環を構成する原子に窒素が存在し、かつその窒素原子がＮＨ構造を取りうる場合は、その窒素原子上の水素原子が、存在する水素の数の範囲で任意のR^{23a}によって窒素原子上で任意に置換されてもよい「３－７員ヘテロシクリル」を表す。このとき、それぞれの「３－７員ヘテロシクリル」の環を構成する炭素原子上の置換基R^{23}及び環を構成するＮＨ構造を取りうる窒素原子に置換される置換基R^{23a}がそれぞれ独立して２個以上存在するとき、それぞれのR^{23}及びR^{23a}は互いに同一でも異なってもよく、更に２つのR^{23}が隣接する場合には、隣接する２つのR^{23}は一緒になって－ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ－を形成することにより、それぞれのR^{23}が結合する炭素原子と共に６員環を形成してもよい。

[0161] 次に、本発明化合物の製造法を以下に説明する。

製造法Ａ

式（１）で表される複素環アミド化合物は、例えば、式（２）で表される化合物と式（３ａ）で表される化合物を反応させることにより製造することができる。

[化9]



(2) (3a) (1)

[0162] 式（２）[式中、Ｑ及びR³は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物又はその塩と、式（３a）[式中、W及びXは前記と同じ意味を表す。]で表される化合物又はその塩を溶媒中、又は無溶媒で、必要であれば塩基、必要であれば縮合剤、必要であれば触媒を使用し、必要であれば添加物を添加して反応させることによって式（１）[式中、Ｑ、R³、W及びXは前記と同じ意味を表す。]で表される本発明化合物を製造することができる。

本反応では式（２）で表される化合物１当量に対して、式（３a）で表される化合物は、０．１から１００当量の範囲で用いることができる。

[0163] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、１，３－ジメチル－２－イミダゾリノン等の極性溶媒、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、１，４－ジオキサン、１，２－ジメトキシエタン、ジフェニルエーテル等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、１，２－ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、ｎ－ペンタン、ｎ－ヘキサン等の脂肪族炭化水素類が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらの内の２種類以上を混合して用いてもよい。

[0164] 塩基を用いる場合、用いられる塩基としては、トリエチルアミン、ピリジン、４－（ジメチルアミノ）ピリジン等の有機塩基、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等の無機塩基を使用することができ、式（２）で表される化合物１当量に対して０．１から５０当量の範囲で用いることができる。

[0165] 縮合剤を用いる場合、用いられる縮合剤としては、１Ｈ－ベンゾトリアゾール－１－イルオキシトリス(ジメチルアミノ)ホスホニウムヘキサフルオロホスファート、Ｎ,Ｎ′－ジシクロヘキシルカルボジイミド、１－(３－ジメチルアミノプロピル)－３－エチルカルボジイミド塩酸塩、２－クロロ－１－メチルピリジニウムヨージド等が挙げられ、式（２）で表される化合物１当量に対して、０．１から５０当量の範囲で用いることができる。

[0166] 添加物を用いる場合、用いられる添加物としては、３Ｈ－［１，２，３］トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジン－３－オール、１－ヒドロキシベンゾトリアゾール等が挙げられ、式（２）で表される化合物１当量に対して、０．１から５０当量の範囲で用いることができる。

[0167] 反応温度は、－７８℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常５分から１００時間の範囲で任意に設定できる。

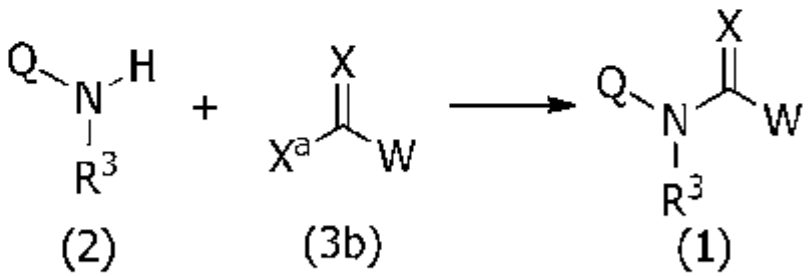
式（２）で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。

式（３a）で表される化合物の或るものは公知化合物であり、文献記載の公知の方法に準じた方法によって合成できる。文献既知の公知の方法とは、例えば、国際公開第２００８／００６５４０号に記載の方法が挙げられる。

[0168] 製造法Ｂ

式（１）で表される複素環アミド化合物は、例えば、式（２）で表される化合物と式（３ｂ）で表される化合物を反応させることにより製造することができる。

[化10]



(2) (3b) (1)

[0169] 式（２）[式中、Ｑ及びＲ^{5}は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物又はその塩と、式（３ｂ）[式中、Ｗ及びＸは前記と同じ意味を表し、Ｘ^{5}はハロゲン原子等の脱離基を表す。]で表される化合物又はその塩を溶媒中、又は無溶媒で、必要であれば塩基を使用して反応させることによって式（１）[式中、Ｑ、Ｒ^{5}、Ｗ及びＸは前記と同じ意味を表す。]で表される本発明化合物を製造することができる。

本反応では式（２）で表される化合物１当量に対して、式（３ｂ）で表される化合物は、０．１から１００当量の範囲で用いることができる。

[0170] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、１，３－ジメチル－２－イミダゾリノン等の極性溶媒、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、１，４－ジオキサン、１，２－ジメトキシエタン、ジフェニルエーテル等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、１，２－ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、ｎ－ペンタン、ｎ－ヘキサン等の脂肪族炭化水素類が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらの内の２種類以上を混合して用いてもよい。

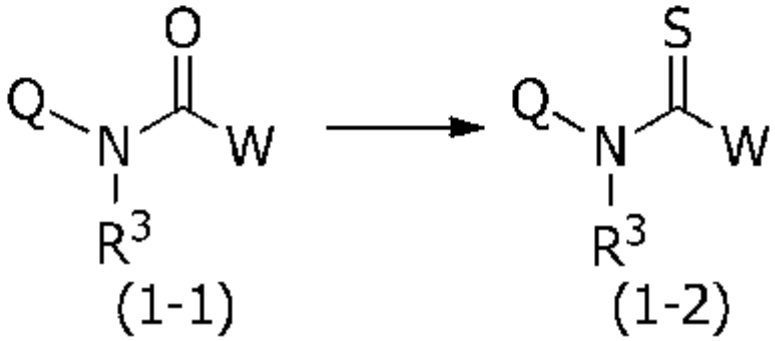
[0171] 塩基を用いる場合、用いられる塩基としては、トリエチルアミン、ピリジン、４－（ジメチルアミノ）ピリジン等の有機塩基、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基を使用することができ、式（２）で表される化合物１当量に対して０．１から５０当量の範囲で用いることができる。これらの塩基は単独で用いても、これらの内の２種類以上を混合して用いてもよい。

[0172] 反応温度は、－７８℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常５分から１００時間の範囲で任意に設定できる。

[0173] 製造法Ｃ

式（１－２）[式中、W、Q及びR^3は前記と同じ意味を表す。]で表される本発明化合物は、例えば、式（１－１）[式中、W、Q及びR^3は前記と同じ意味を表す。]で表される本発明化合物と五硫化二燐、五硫化二燐－ＨＭＤＯ(ヘキサメチルジシロキサン)、ローソン試薬(Ｌａｗｅｓｓｏｎ’ｓ　Ｒｅａｇｅｎｔ；２,４－ビス(４－メトキシフェニル)－１,３,２,４－ジチアジホスフェタン－２,４－ジスルフィド)等の硫化剤を反応させることにより製造することができる。

[化11]



[0174] 本反応で用いる硫化剤は、式（１－１）で表される化合物１当量に対して０．５～５０当量の範囲で用いることができる。

必要ならば、炭酸カリウム、トリエチルアミン、ピリジン、４－（ジメチルアミノ）ピリジン等の塩基を使用することができる。

[0175] 本反応は、無溶媒でも実施することができるが、溶媒を用いてもよい。例えば、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、１，３－ジメチル－２－イミダゾリノン、水等の極性溶媒、メタノール、エタノール、プロパノール、２－プロパノール、エチレングリコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジフェニルエーテル等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ペンタン、ｎ－ヘキサン等の脂肪族炭化水素類が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらの内の２種類以上

を混合して用いてもよい。

反応温度は、－６０℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常５分から１００時間の範囲で任意に設定できる。

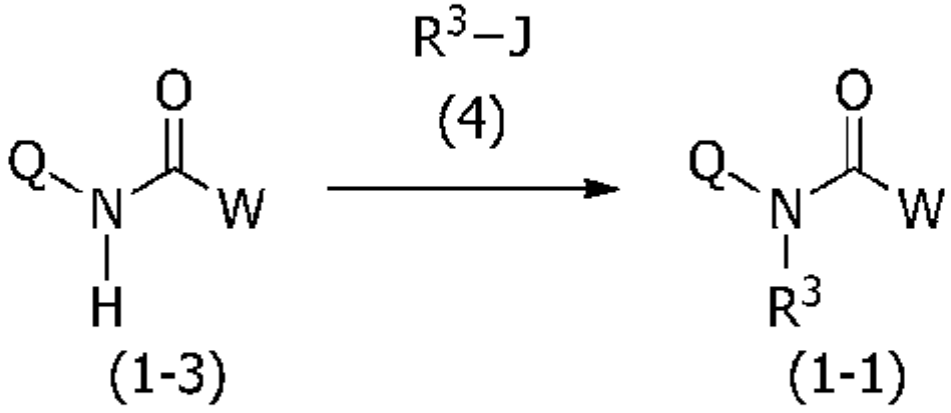
[0176] 製造法Ａ～製造法Ｃにおいて、反応終了後の反応混合物は、直接濃縮、又は有機溶媒に溶解し、水洗後濃縮、又は氷水に投入、有機溶媒抽出後濃縮といった通常の後処理を行い、本発明化合物を得ることができる。また、精製の必要が生じたときには、再結晶、カラムクロマトグラフ、薄層クロマトグラフ、液体クロマトグラフ分取等の任意の精製方法によって分離、精製することができる。

式（３ｂ）で表される化合物の或るものは、以下に示す反応式１によって合成することができる。

[0177] 製造法Ｄ

式（１－１）で表される複素環アミド化合物は、例えば、式（１－３）[式中、Ｗ及びＱは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と式（４）[式中、R^3は前記と同じ意味を表し、Ｊはハロゲン原子、－ＯＨ、$-OSO_2Me$、$-OSO_2CF_3$等の脱離基を表す。] で表される化合物を反応させることにより製造することができる。

[化12]



[0178] 本反応は、式（１－３）で表される化合物１当量に対して、式（４）で表される化合物を、０．５～５０当量の範囲で用いることができる。必要なら

ば塩酸、硫酸、ｐ－トルエンスルホン酸等の酸、炭酸カリウム、トリエチルアミン、ピリジン、４－（ジメチルアミノ）ピリジン、水素化ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の塩基を、又は、ジエチルアゾジカルボキシレート及びトリフェニルホスフィン等を使用する光延反応を使用することができる。

[0179] 本反応は、無溶媒でも実施することができるが、溶媒を用いてもよい。例えば、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、１，３－ジメチル－２－イミダゾリノン、水等の極性溶媒、メタノール、エタノール、プロパノール、２－プロパノール、エチレングリコール等のアルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジフェニルエーテル等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ペンタン、ｎ－ヘキサン等の脂肪族炭化水素類が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらの内の２種類以上を混合して用いてもよい。

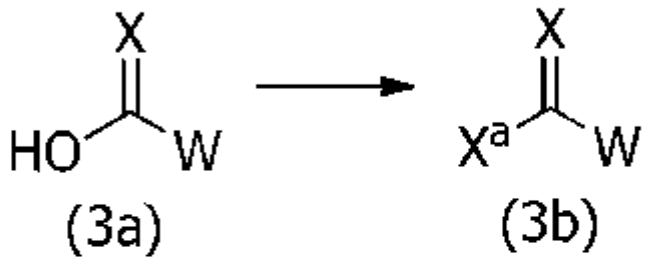
[0180] 反応温度は、－６０℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常５分から１００時間の範囲で任意に設定できる。

式（４）で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載の公知の方法に準じて合成することができる。

[0181] 反応式１

式（３ｂ）で表される化合物は、例えば、式（３ａ）で表される化合物とハロゲン化剤を反応させることにより製造することができる。

[化13]



[0182] 式（３ａ）[式中、W及びXは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物又はその塩と、ハロゲン化剤を溶媒中、又は無溶媒で、必要であれば塩基を使用して反応させることによって式（３ｂ）[式中、W、X及びXaは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を製造することができる。

ハロゲン化剤としては、例えば塩化チオニル、塩化オキサリル、塩化ホスホリル等が挙げられる。ハロゲン化剤の当量としては、式（３ａ）で表される化合物１当量に対して、０．１から１００当量の範囲で用いることができる。

[0183] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、１，３－ジメチル－２－イミダゾリノン等の極性溶媒、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、１，４－ジオキサン、１，２－ジメトキシエタン、ジフェニルエーテル等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、１，２－ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、ｎ－ペンタン、ｎ－ヘキサン等の脂肪族炭化水素類が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらの内の２種類以上を混合して用いてもよい。

[0184] 塩基を用いる場合、用いられる塩基としては、トリエチルアミン、ピリジン、４－（ジメチルアミノ）ピリジン等の有機塩基、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基を使用することができ、式（３ａ）で表される化合物１当量に対し

て０．１から５０当量の範囲で用いることができる。これらの塩基は単独で用いても、これらの内の２種類以上を混合して用いてもよい。

[0185] 反応温度は、－７８℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常５分から１００時間の範囲で任意に設定できる。

反応終了後、通常の後処理を行うことにより製造法Ｂの原料化合物となる製造中間体を得ることができる。

また、この方法により製造された製造中間体は、単離・精製することなく、そのまま次工程の反応に用いることもできる。

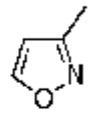
[0186] 本発明に包含される活性化合物としては、具体的に例えば第１表乃至第３表に示す化合物が挙げられる。但し、第１表乃至第３表の化合物は例示のためのものであって、本発明はこれらのみに限定されるものではない。尚、表中、Ｍｅと記載される置換基はメチル基を表し、以下、Ｅｔとの記載はエチル基を表し、ｎ－Ｐｒ及びＰｒ－ｎはノルマルプロピル基を、ｉ－Ｐｒ及びＰｒ－ｉはイソプロピル基を、ｃ－Ｐｒ及びＰｒ－ｃはシクロプロピル基を、ｎ－Ｂｕ及びＢｕ－ｎはノルマルブチル基を、ｓ－Ｂｕ及びＢｕ－ｓはセカンダリーブチル基を、ｉ－Ｂｕ及びＢｕ－ｉはイソブチル基を、ｔ－Ｂｕ及びＢｕ－ｔはターシャリーブチル基を、ｃ－Ｂｕ及びＢｕ－ｃはシクロブチル基を、ｎ－Ｐｅｎ及びＰｅｎ－ｎはノルマルペンチル基を、ｉ－Ｐｅｎ及びＰｅｎ－ｉはイソペンチル基を、ｓ－Ｐｅｎ及びＰｅｎ－ｓはセカンダリーペンチル基を、ｔ－Ｐｅｎ及びＰｅｎ－ｔはターシャリーペンチル基を、ｃ－Ｐｅｎ及びＰｅｎ－ｃはシクロペンチル基を、３－Ｐｅｎは－ＣＨ（Ｅｔ）$_2$基を、ｎ－Ｈｅｘ及びＨｅｘ－ｎはノルマルヘキシル基を、ｃ－Ｈｅｘ及びＨｅｘ－ｃはシクロヘキシル基を、Ｐｈはフェニル基をそれぞれ表す。

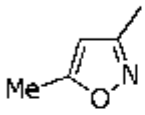
[0187] 表中、Ｄ－３、Ｄ－３ａ、Ｄ－４、Ｄ－４ａ、Ｄ－４ｂ、Ｄ－８、Ｄ－８ａ、Ｄ－８ｂ、Ｄ－８ｃ、Ｄ－８ｄ、Ｄ－８ｅ、Ｄ－８ｆ、Ｄ－８ｇ、Ｄ－８ｈ、Ｄ－９、Ｄ－９ａ、Ｄ－９ｂ、Ｄ－９ｃ、Ｄ－９ｄ、Ｄ－９ｅ、Ｄ－

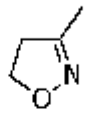
９ｆ、Ｄ－９ｇ、Ｄ－９ｈ、Ｄ－９ｉ、Ｄ－９ｊ、Ｄ－９ｋ、Ｄ－９ｍ、Ｄ－１０ａ、Ｄ－１１、Ｄ－１２、Ｄ－１３ａ、Ｄ－１４、Ｄ－１５、Ｄ－１６、Ｄ－１６ａ、Ｄ－１６ｂ、Ｄ－１６ｃ、Ｄ－１６ｄ、Ｄ－１６ｅ、Ｄ－１６ｆ、Ｄ－１６ｇ、Ｄ－１６ｈ、Ｄ－１６ｉ、Ｄ－１６ｊ、Ｄ－１６ｋ、Ｄ－１６ｍ、Ｄ－１６ｎ、Ｄ－１６ｐ、Ｄ－１７、Ｄ－１７ａ、Ｄ－１７ｂ、Ｄ－１８、Ｄ－１９、Ｄ－２１、Ｄ－２４ａ、Ｄ－２４ｂ、Ｄ－２４ｃ、Ｄ－２４ｄ、Ｄ－２４ｅ及びＤ－２４ｆで表される構造は下記の構造を表す。

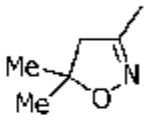
[0188]

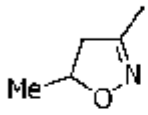
[化14]

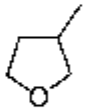

D-3

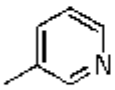

D-3a

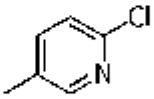

D-4

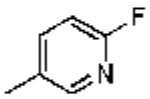

D-4a

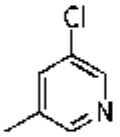

D-4b

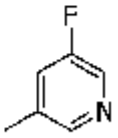

D-5

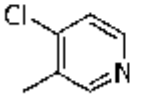

D-8

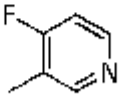

D-8a

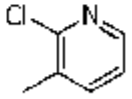

D-8b

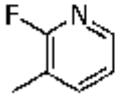

D-8c

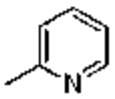

D-8d

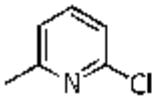

D-8e

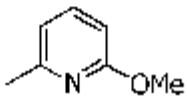

D-8f

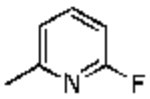

D-8g

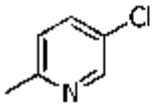

D-8h

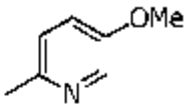

D-9

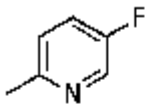

D-9a

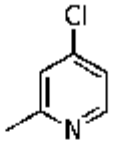

D-9b

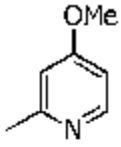

D-9c

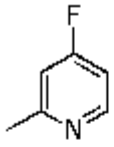

D-9d

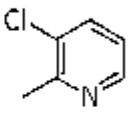

D-9e

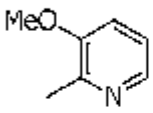

D-9f

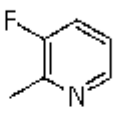

D-9g

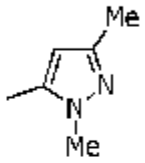

D-9h

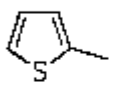

D-9i


D-9j

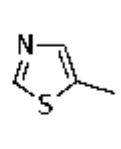

D-9k

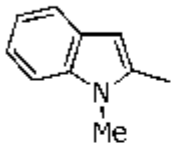

D-9m

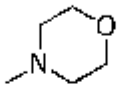

D-10a

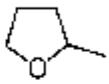

D-11

[化15]

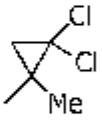

D-12

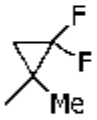

D-13a

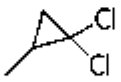

D-14


D-15

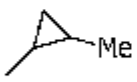
D-16

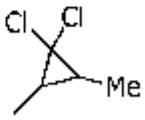

D-16a

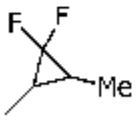

D-16b

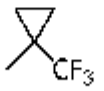

D-16c

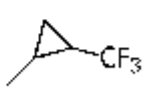
D-16d

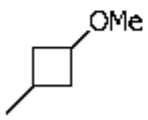

D-16e

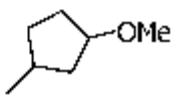

D-16f

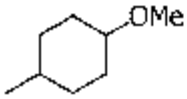

D-16g

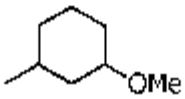

D-16h

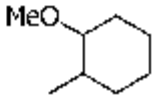

D-16i

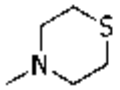

D-16j

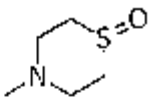

D-16k

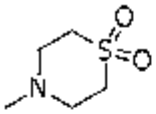

D-16m

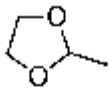

D-16n

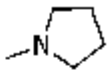

D-16p


D-17


D-17a


D-17b

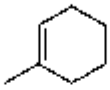

D-18

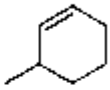

D-19

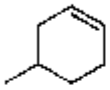
D-24a

D-24b

D-24c

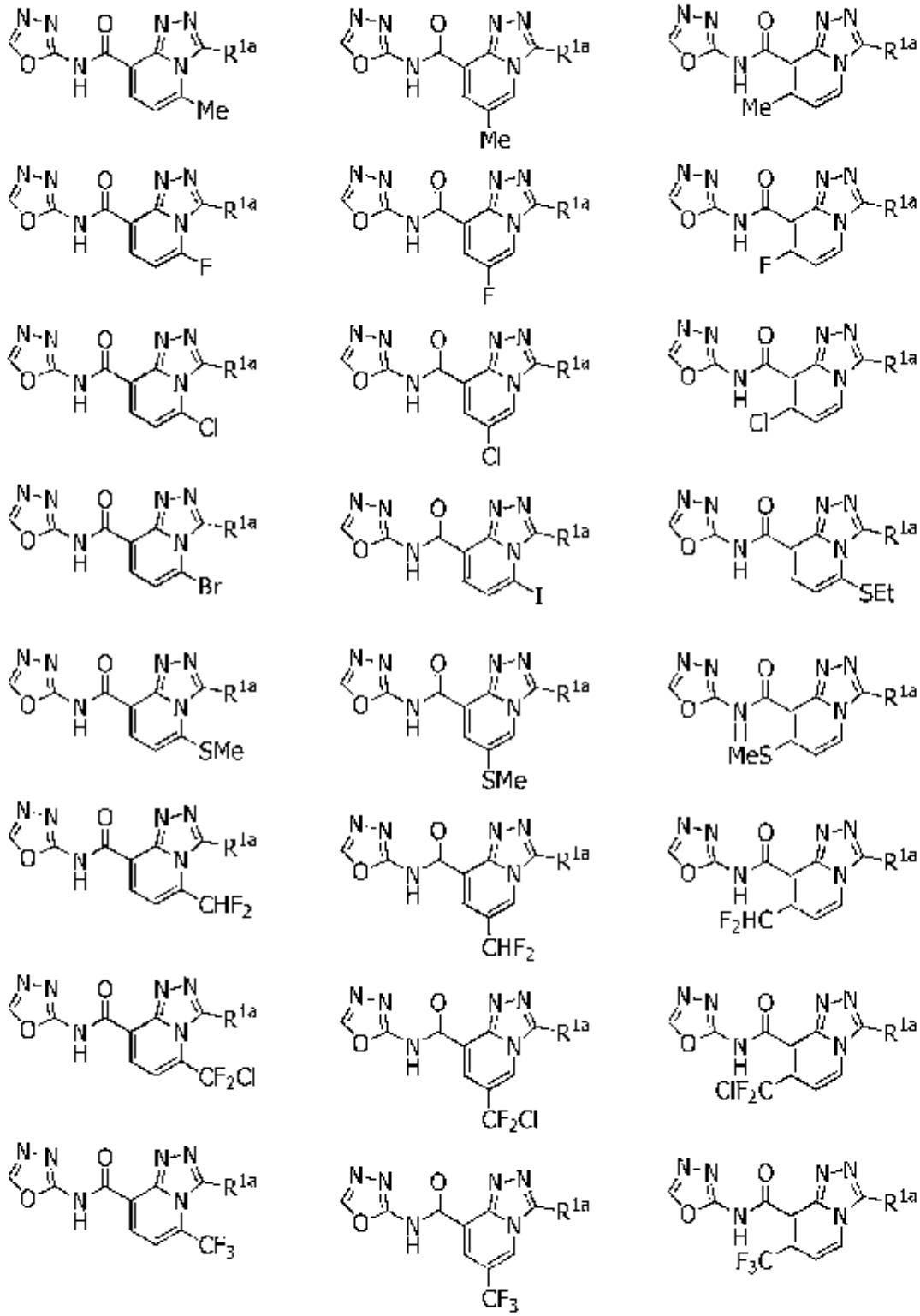

D-24d


D-24e

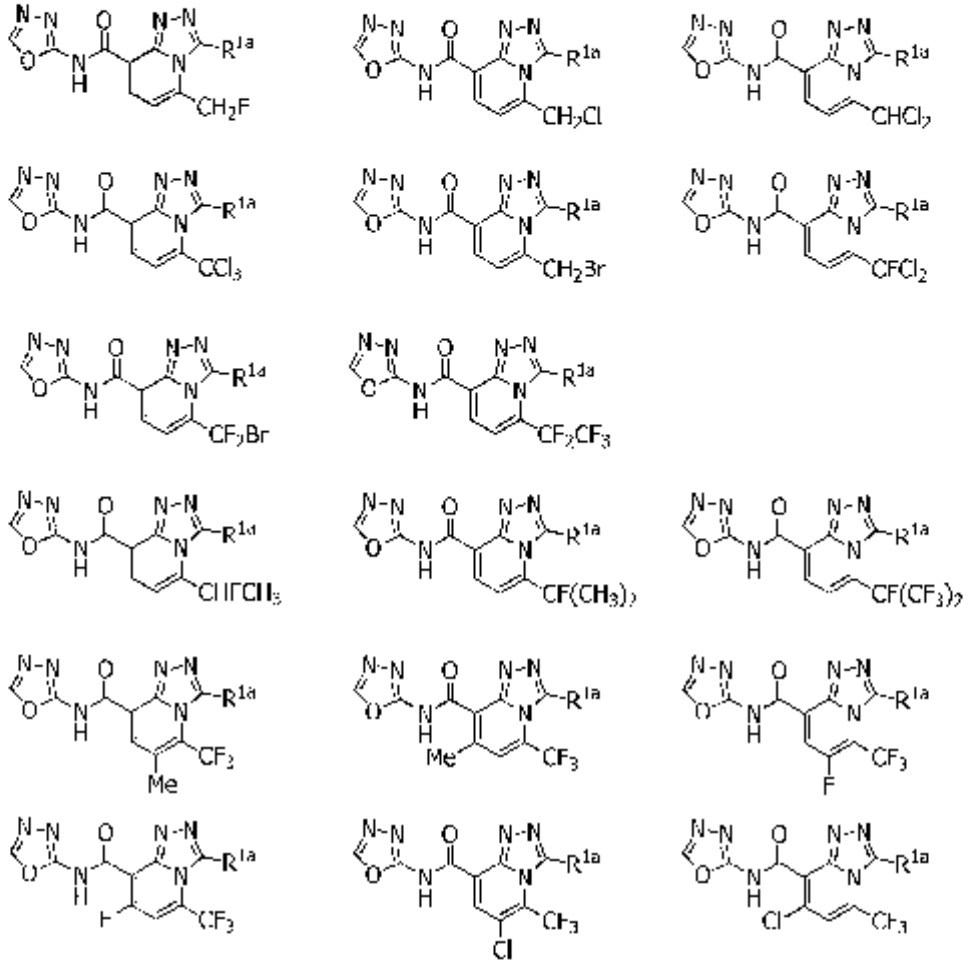

D-24f

[0189] [第1表]

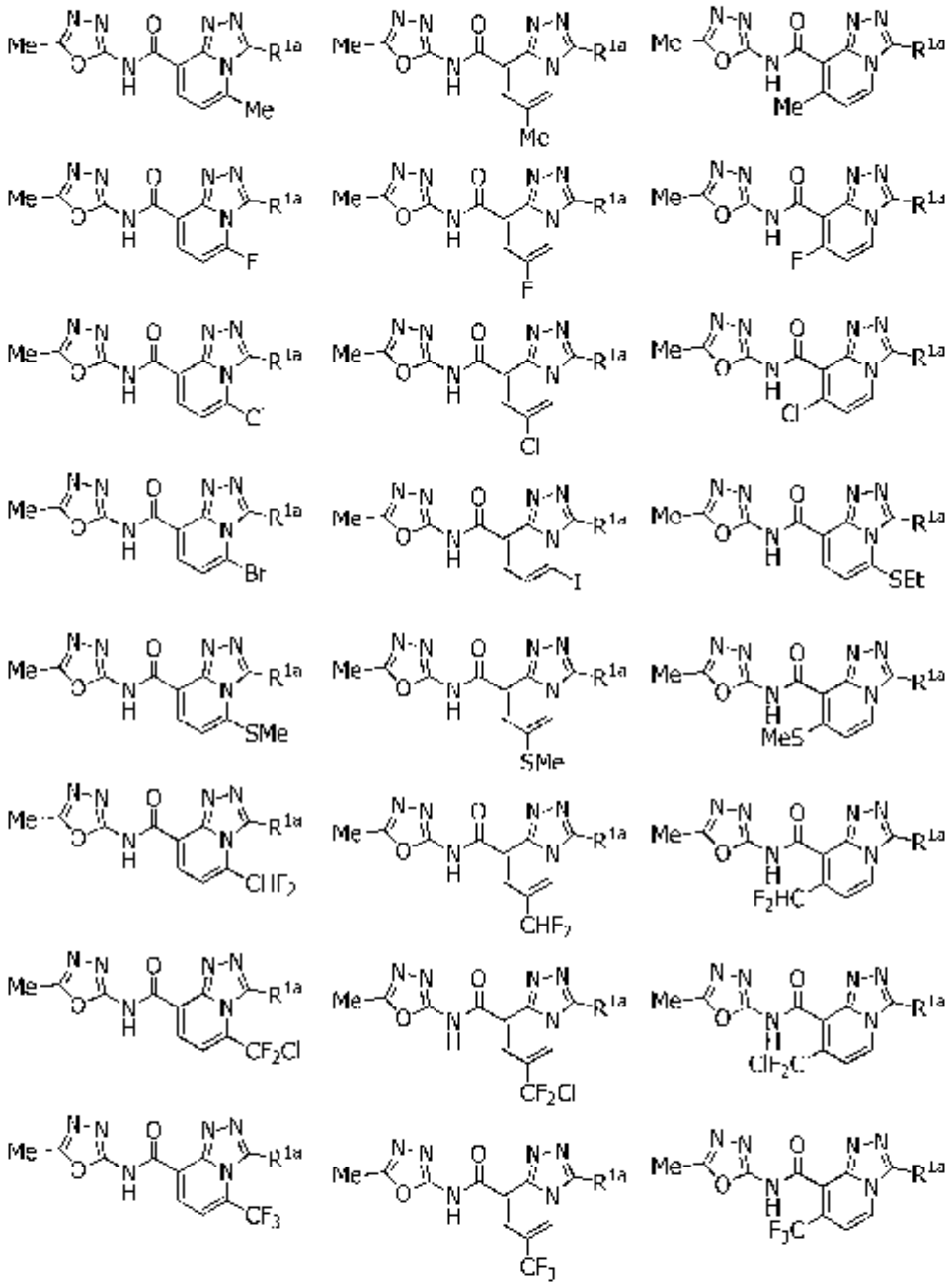
[化16]



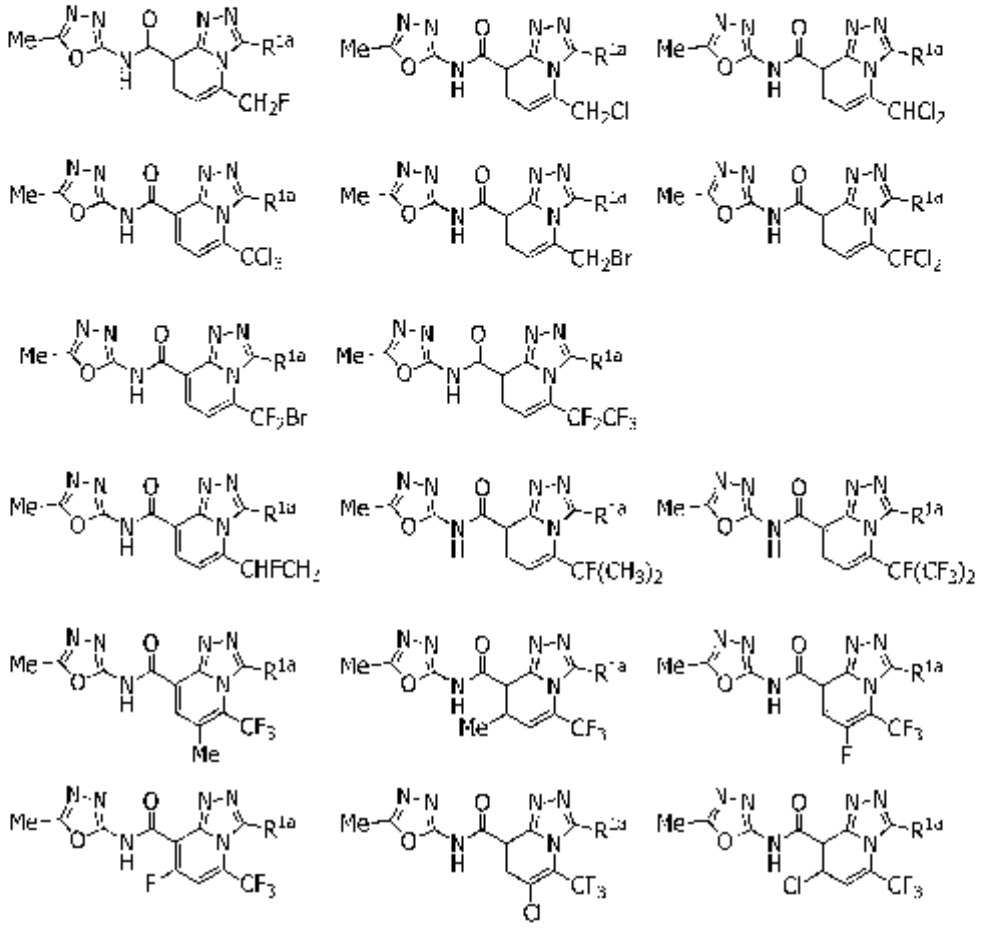
[化17]



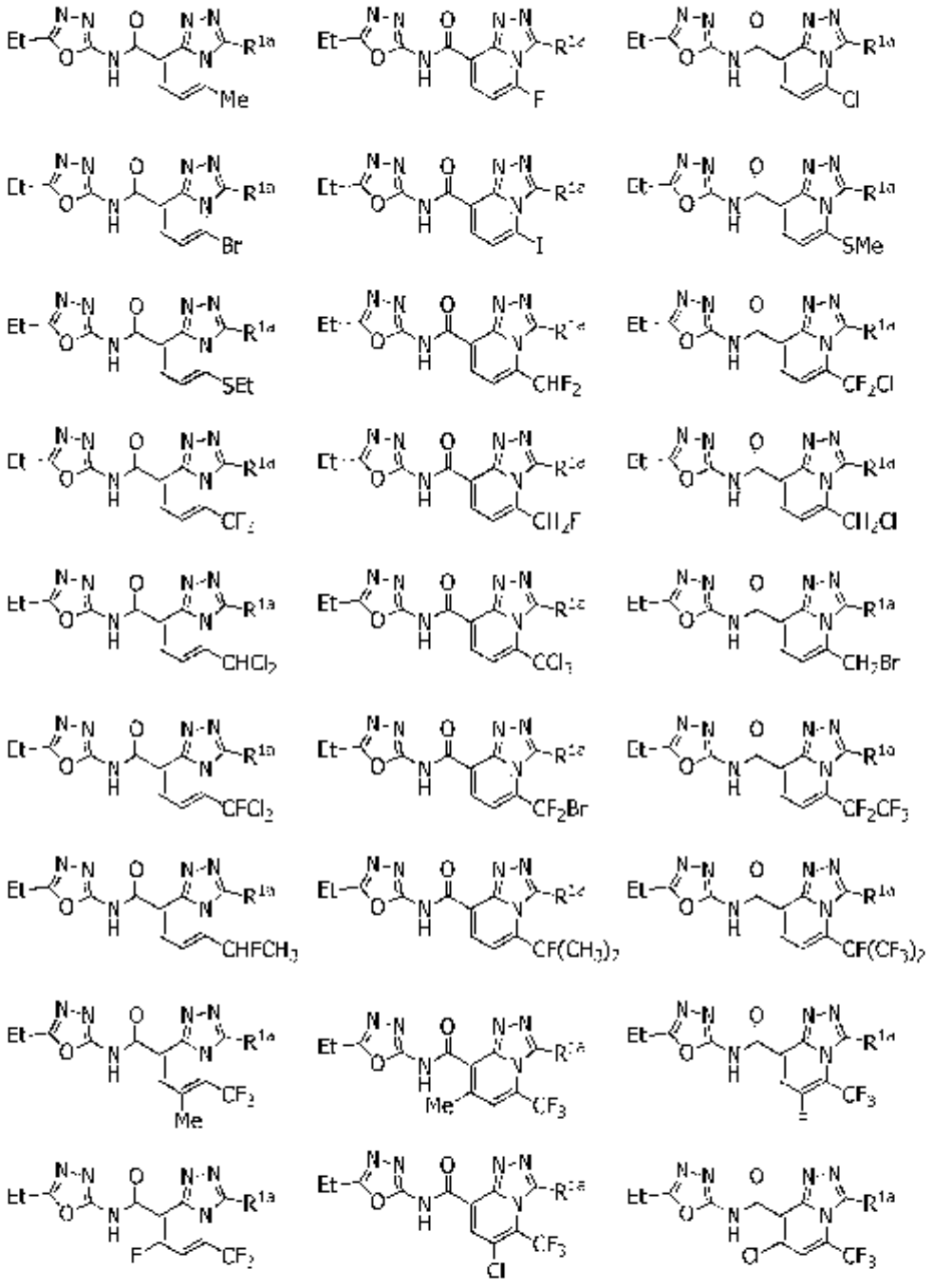
[化18]



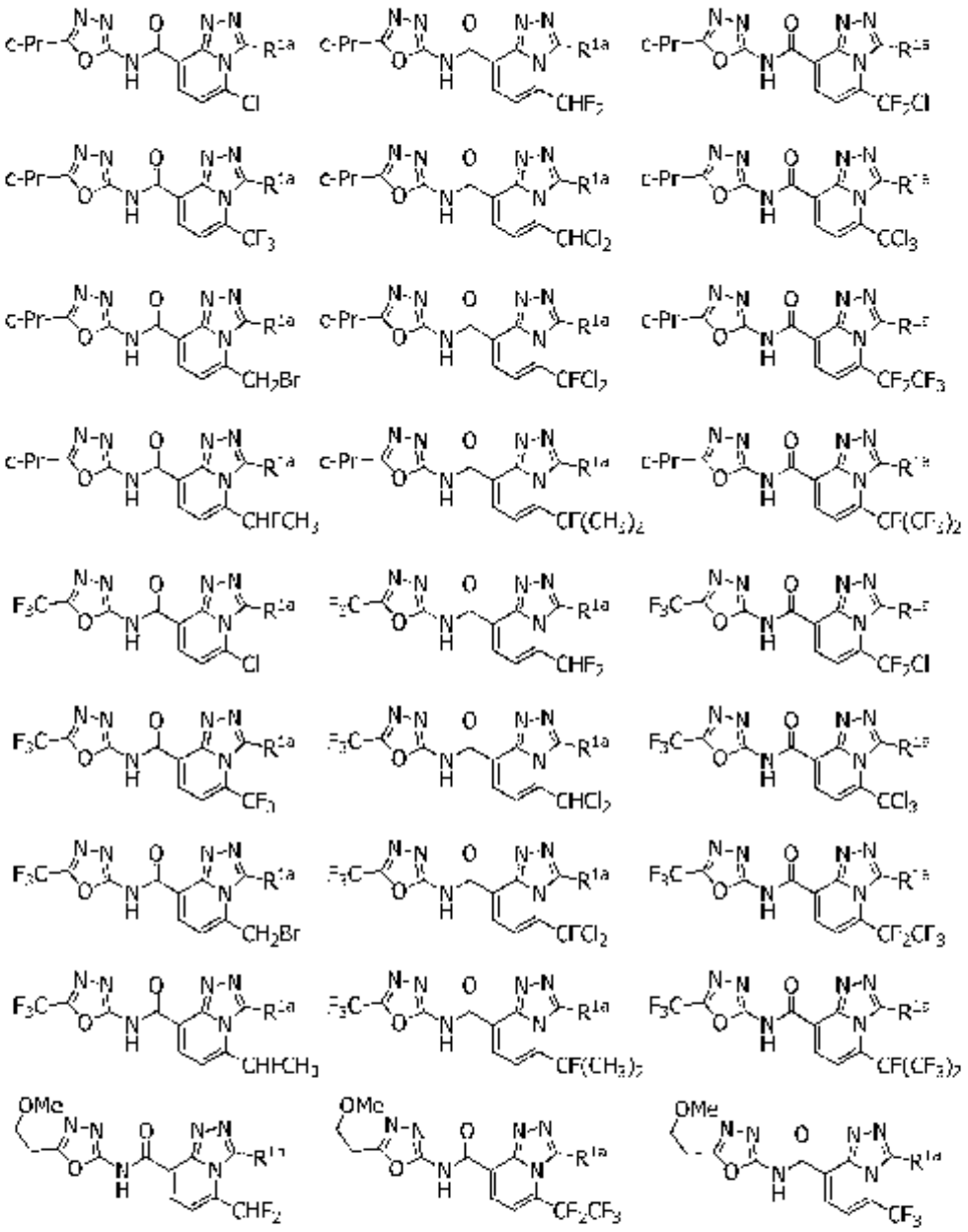
[化19]



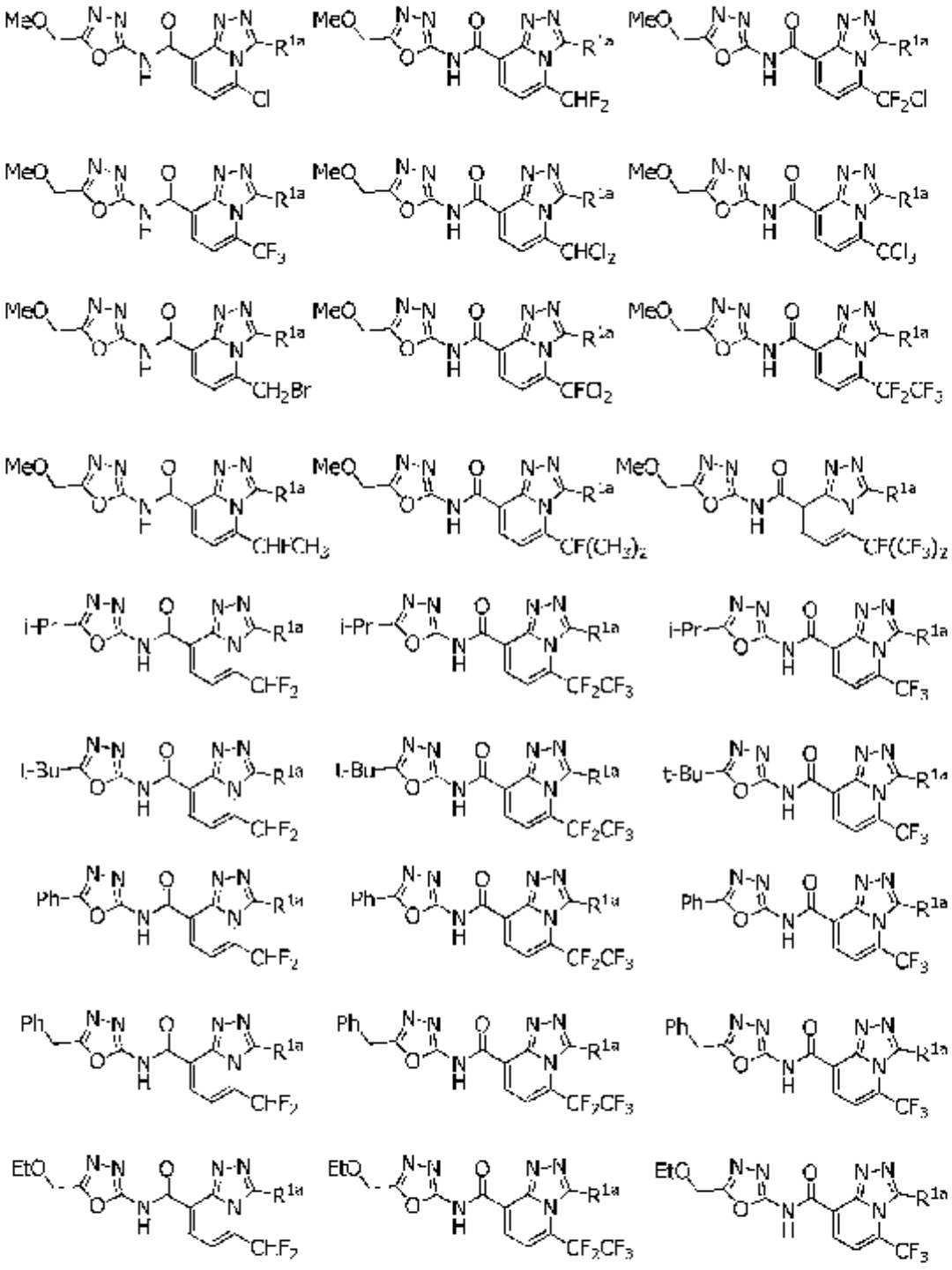
[化20]



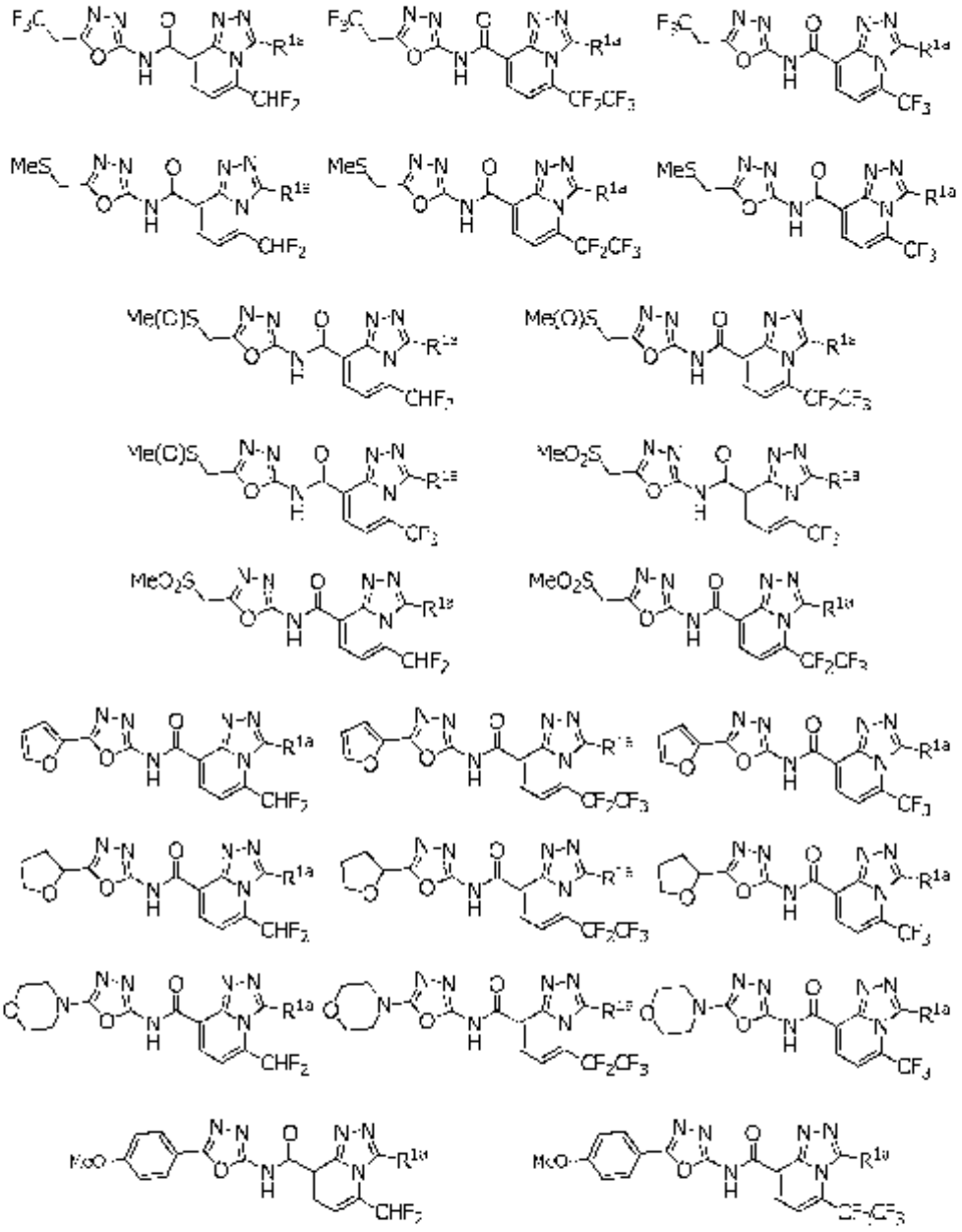
[化21]



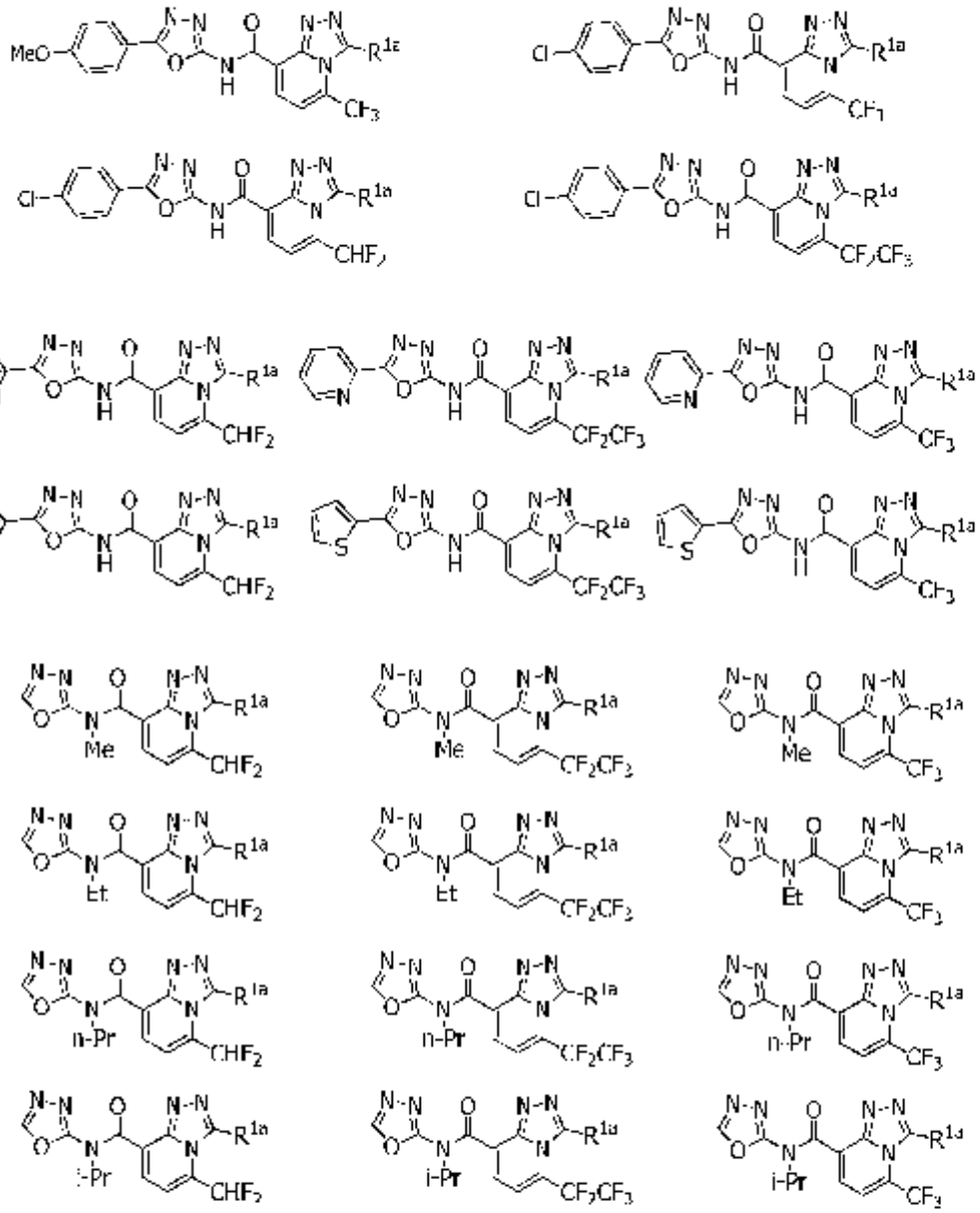
[化22]



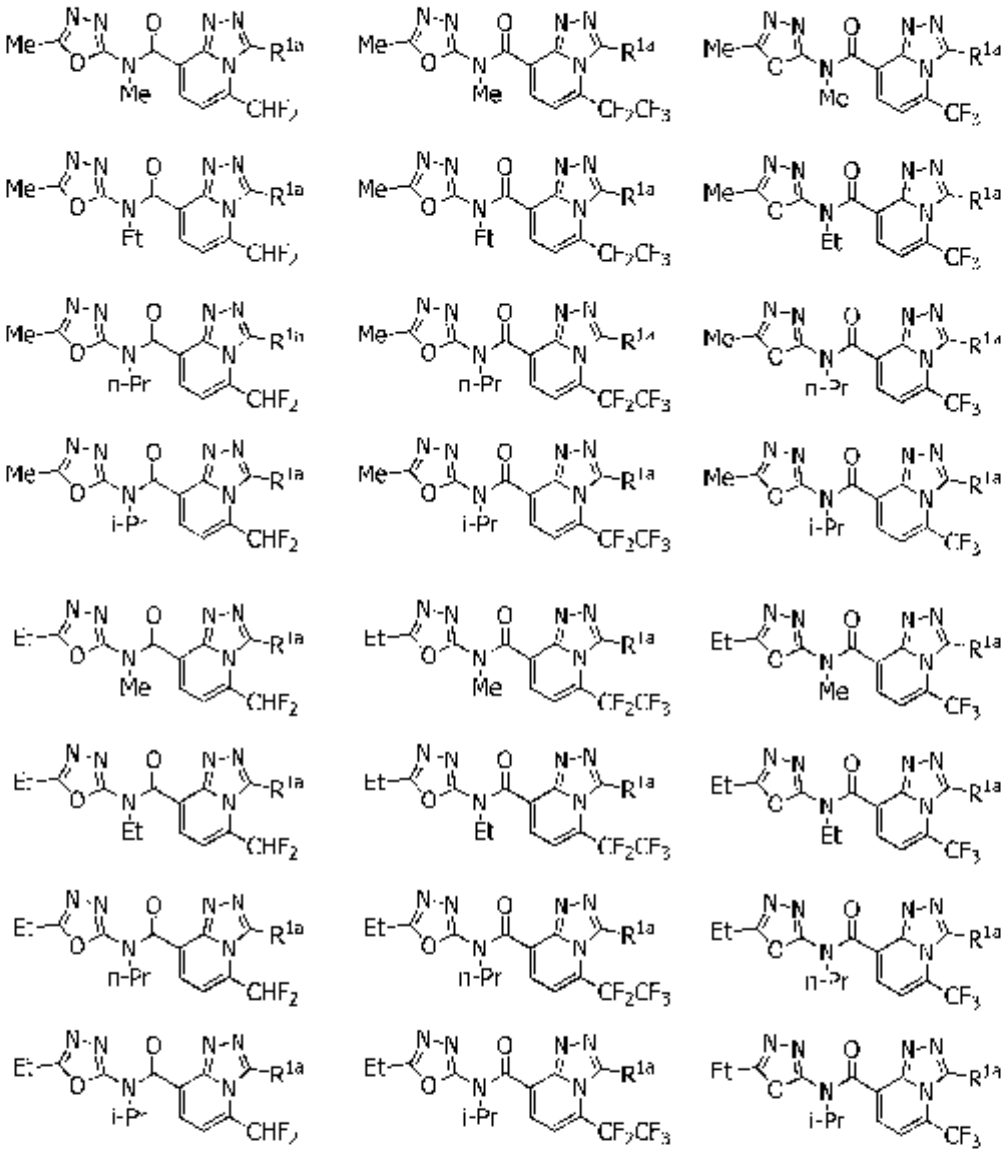
[化23]



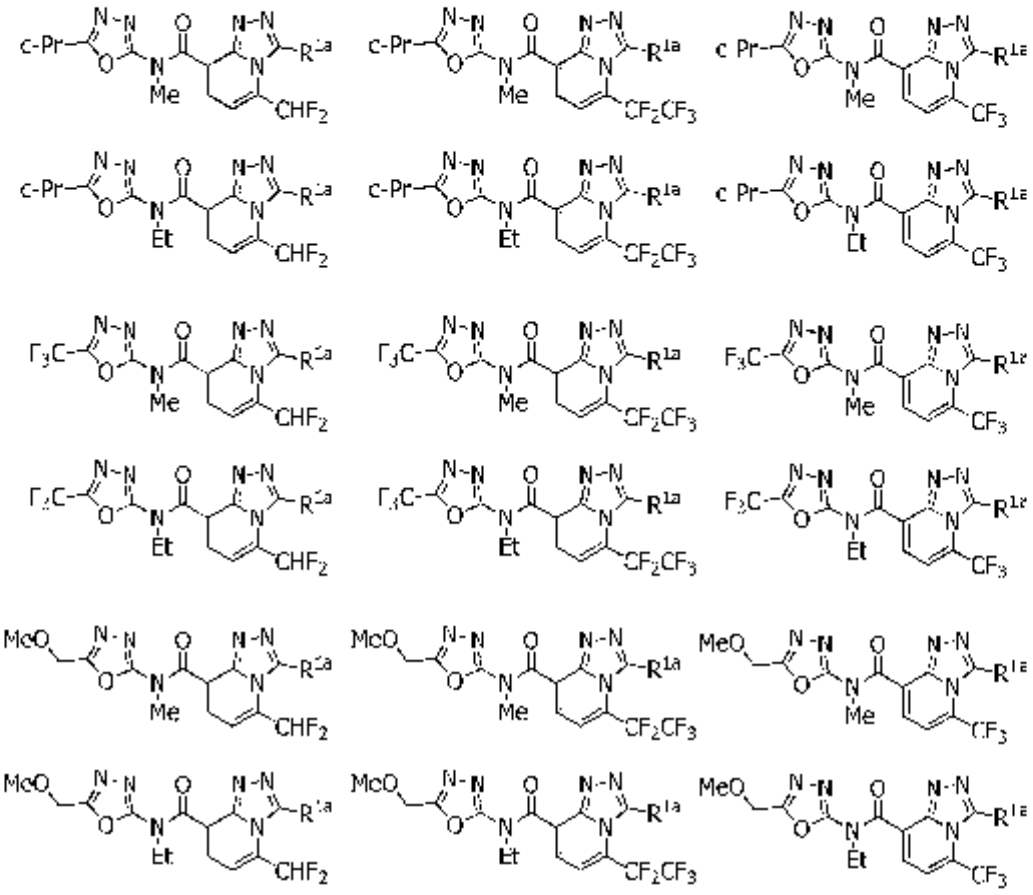
[化24]



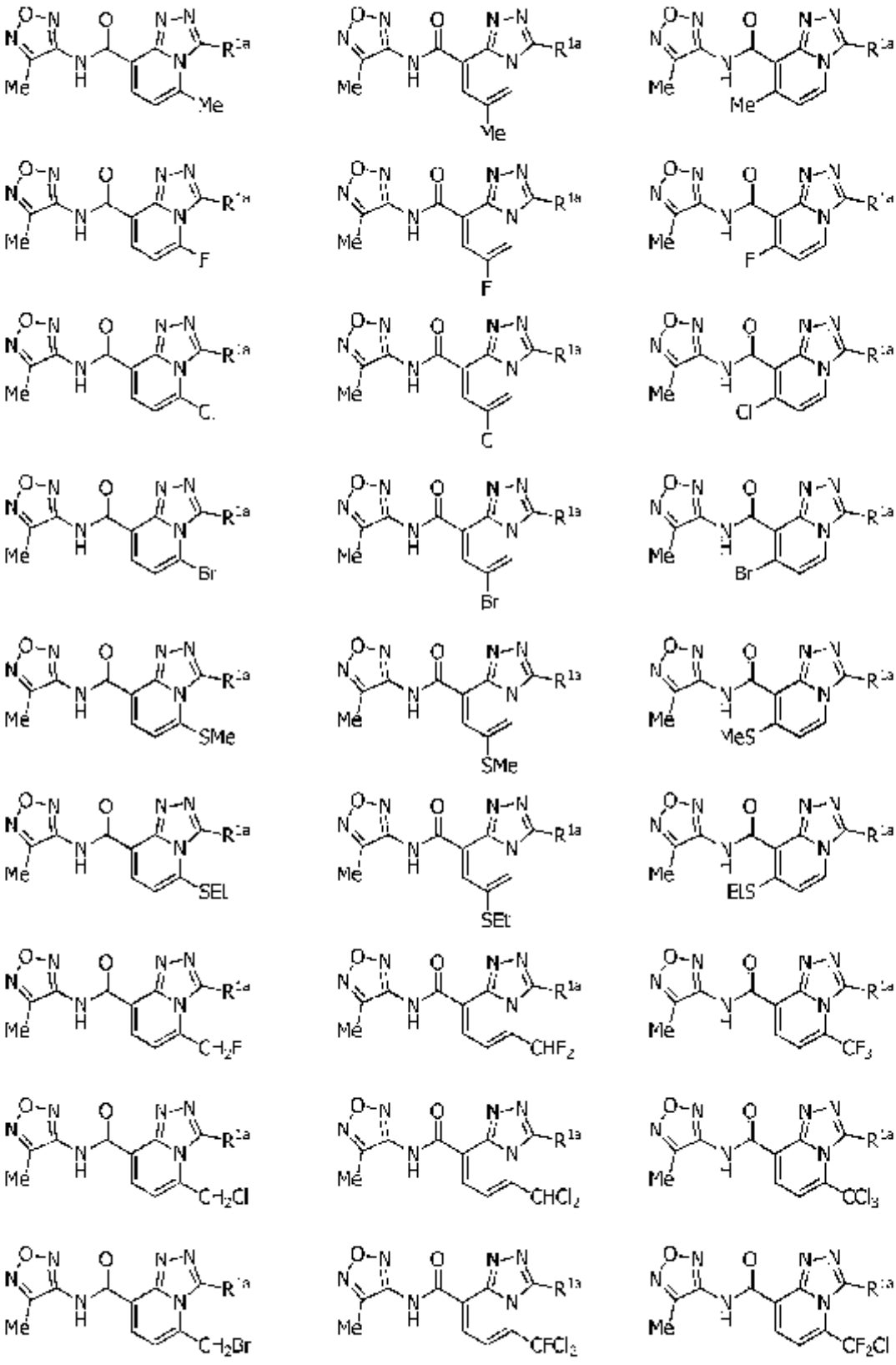
[化25]



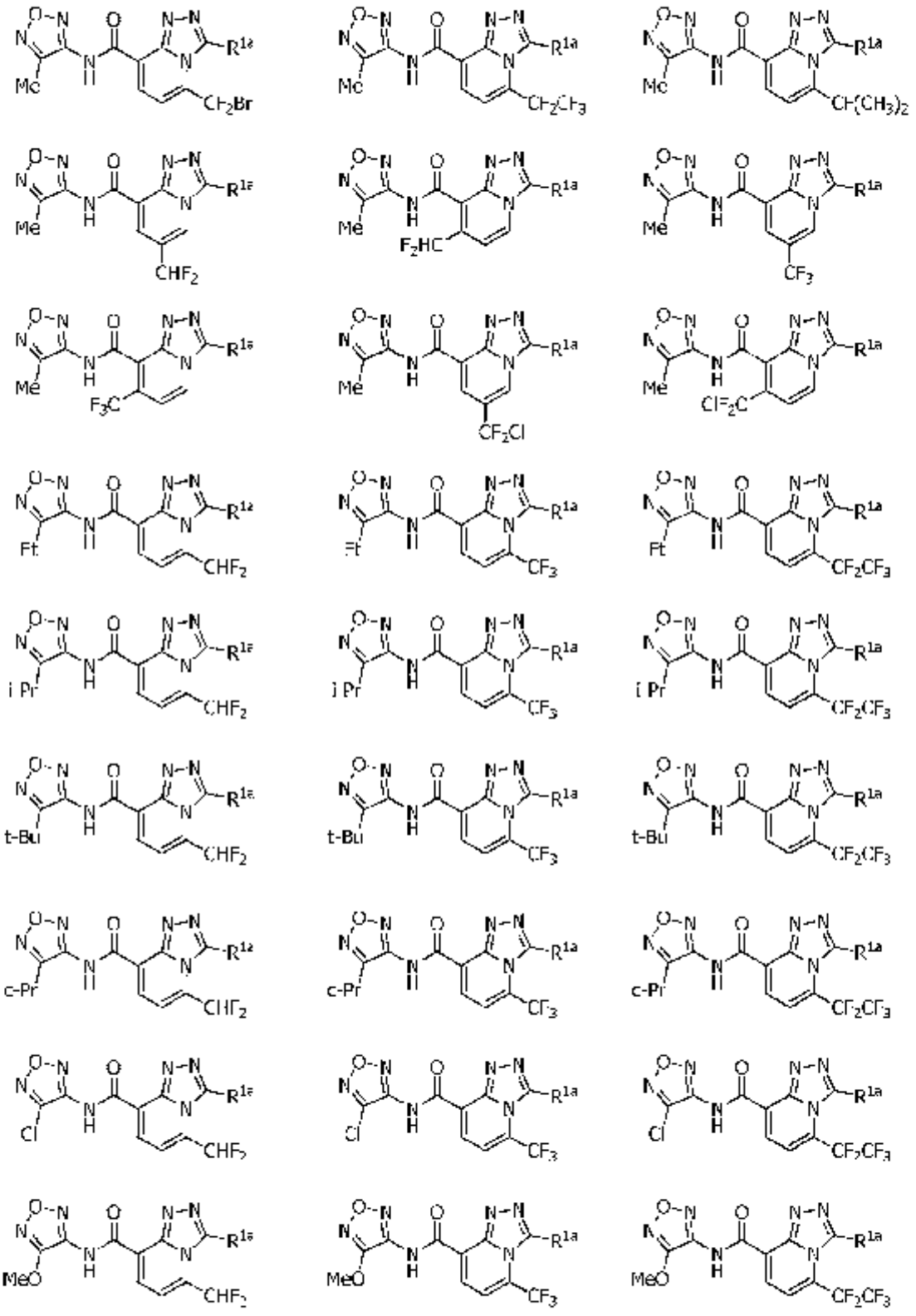
[化26]



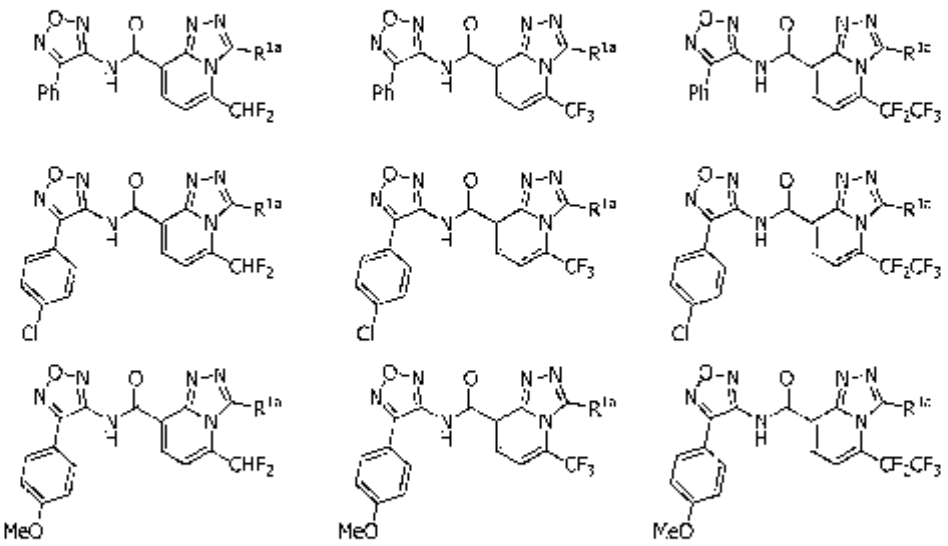
[化27]



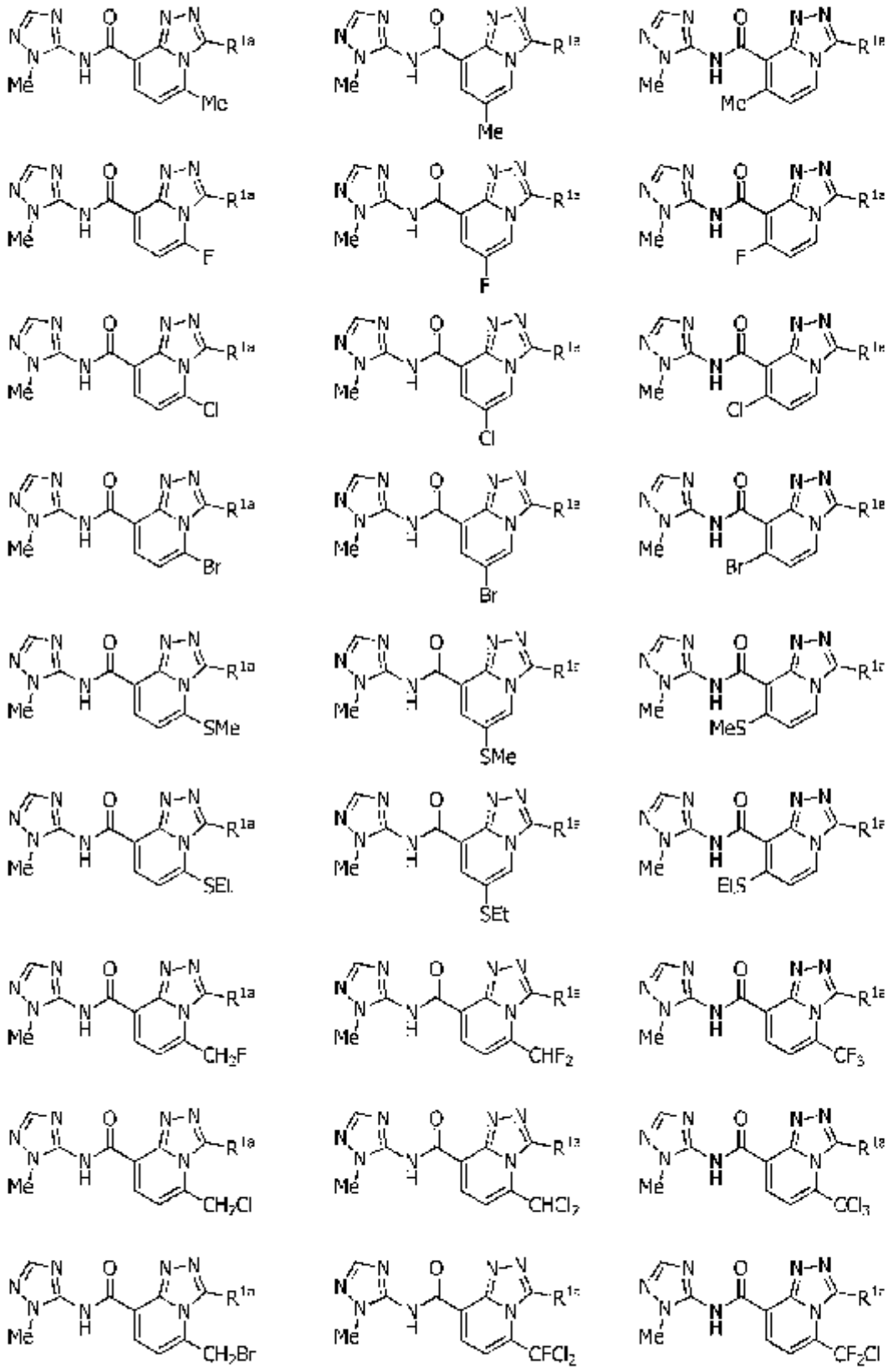
[化28]



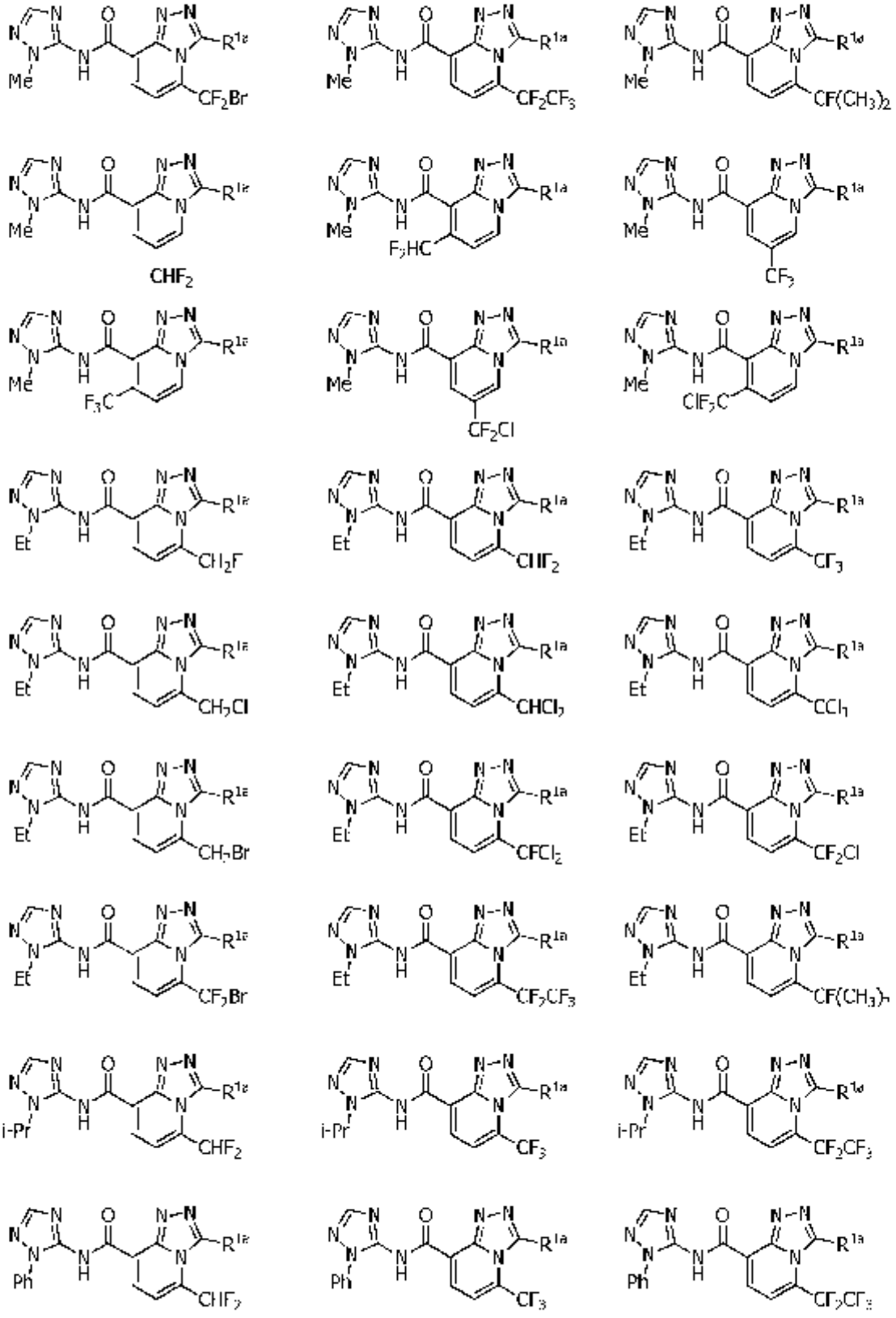
[化29]



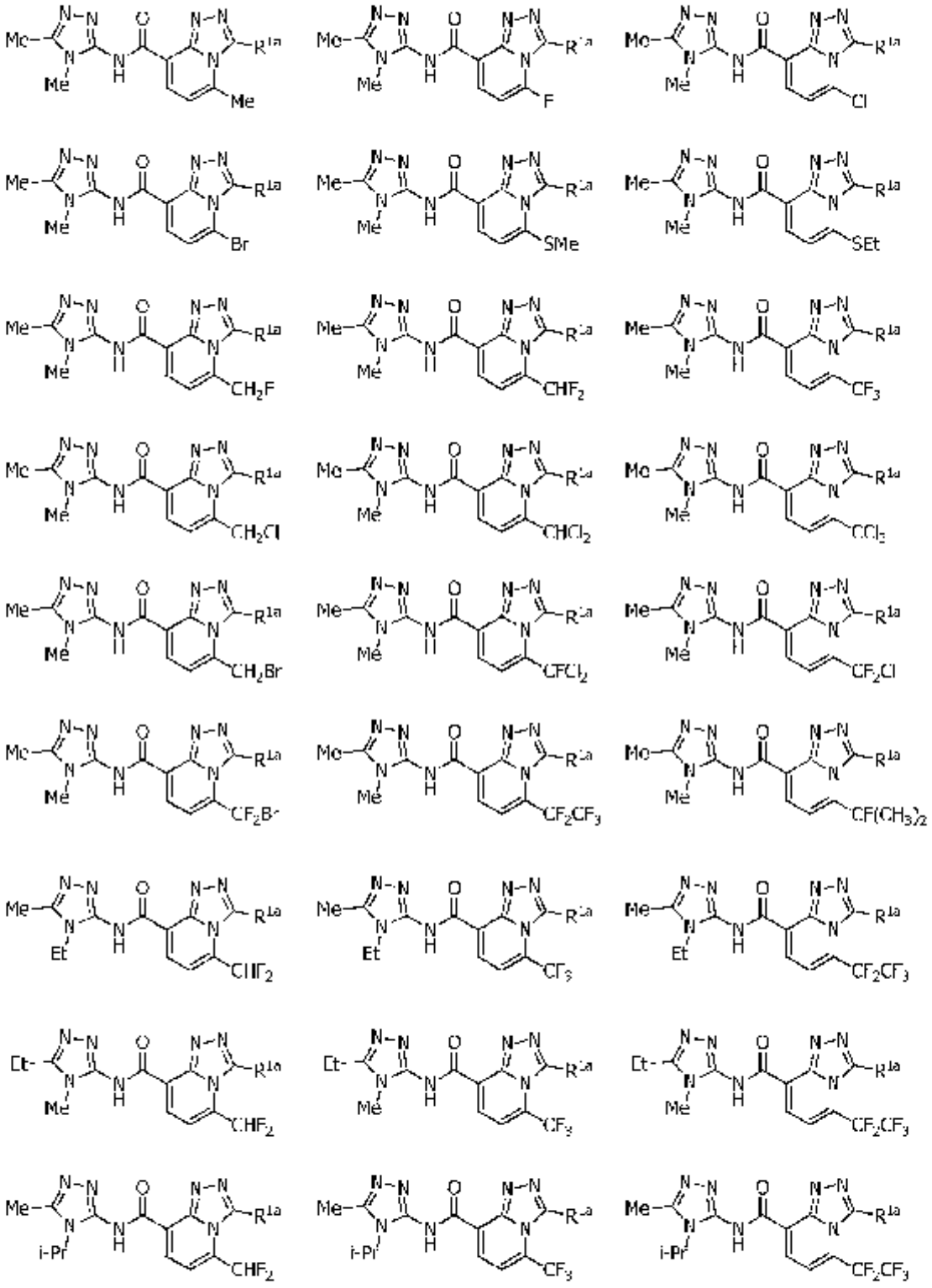
[化30]



[化31]



[化32]



[表1]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
H	CH_2CF_3	$C(Me)_2CH_2CN$
F	$(CH_2)_3Cl$	CH_2Pr-c
Cl	$(CH_2)_3Br$	CH_2(D-16)
Br	$(CH_2)_2CF_3$	CH_2(D-16d)
I	$CHFCH_3$	CH_2Bu-c
Me	CF_2CH_3	CH_2Pen-c
Et	$CF(CH_3)_2$	CH_2Hex-c
Pr-n	CF_2CF_2H	CH(Me)Pr-c
Pr-i	CF_2CF_3	CH(Me)(D-16)
Pr-c	$CF_2CF_2CF_3$	CH(Me)(D-16e)
Bu-n	$CF(CF_3)_2$	CH(Me)Bu-c
Bu-i	CH(Me)Cl	CH(Me)Pen-c
Bu-c	CH(Me)Br	CH(Me)Hex-c
Bu-s	CH(Et)Cl	$(CH_2)_2Pr$-c
Bu-t	CH(Et)Br	$(CH_2)_2$(D-16)
Pen-n	CH(Pr-n)Cl	$(CH_2)_2$(D-16e)
Pen-i	CH(Pr-n)Br	$(CH_2)_2Bu$-c
Pen-c	CH(Pr-i)Cl	$(CH_2)_2Pen$-c
Pen-s	CH(Pr-i)Br	$(CH_2)_2Hex$-c
Pen-t	$C(Me)_2Cl$	CH_2OMe
3-Pen	$C(Me)_2Br$	CH_2OEt
Hex-n	$CH(Me)CH_2Cl$	CH_2OPr-n
Hex-c	$CH(Me)CH_2Br$	CH_2OPr-i
CH_2Cl	$C(Me)_2CH_2Cl$	CH_2OBu-n
CH_2Br	$C(Me)_2CH_2Br$	CH_2OBu-i
$CHBr_2$	CH_2CN	CH_2OBu-s
CF_2H	$(CH_2)_2CN$	CH_2OBu-t
CF_2Cl	$(CH_2)_3CN$	CH_2OPen-n
CF_2Br	CH(Me)CN	CH_2OPen-i
CF_3	CH(Et)CN	CH_2OPen-s
$(CH_2)_2Cl$	CH(Pr-n)CN	CH_2OPen-t
$(CH_2)_2Br$	CH(Pr-i)CN	CH_2OHex-n
CH_2CF_2H	$C(Me)_2CN$	CH(Me)OMe
CH_2CF_2Cl	$CH(Me)CH_2CN$	CH(Me)OEt
CH_2CF_2Br	$CH(Et)CH_2CN$	CH(Me)OPr-n

[表2]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
CH(Me)OPr-i	C(Me)$_2$OBu-n	CH$_2$O(CH$_2$)$_2$Cl
CH(Me)OBu-n	C(Me)$_2$OBu-i	CH$_2$O(CH$_2$)$_2$Br
CH(Me)OBu-i	C(Me)$_2$OBu-s	CH(Me)OCF$_2$H
CH(Me)OBu-s	C(Me)$_2$OBu-t	CH(Me)OCF$_3$
CH(Me)OBu-t	(CH$_2$)$_2$OMe	CH(Me)OCH$_2$CF$_2$H
CH(Me)OPen-n	(CH$_2$)$_2$OEt	CH(Me)OCH$_2$CF$_3$
CH(Me)OPen-i	(CH$_2$)$_2$OPr-n	CH(Me)O(CH$_2$)$_2$CF$_3$
CH(Me)OPen-s	(CH$_2$)$_2$OPr-i	CH(Me)O(CH$_2$)$_2$Cl
CH(Me)OPen-t	(CH$_2$)$_2$OBu-n	CH(Me)O(CH$_2$)$_2$Br
CH(Me)OHex-n	(CH$_2$)$_2$OBu-i	CH(Et)OCF$_2$H
CH(Et)OMe	(CH$_2$)$_2$OBu-s	CH(Et)OCF$_3$
CH(Et)OEt	(CH$_2$)$_2$OBu-t	CH(Et)OCH$_2$CF$_2$H
CH(Et)OPr-n	CH(Me)CH$_2$OMe	CH(Et)OCH$_2$CF$_3$
CH(Et)OPr-i	CH(Me)CH$_2$OEt	CH(Et)O(CH$_2$)$_2$CF$_3$
CH(Et)OBu-n	CH(Me)CH$_2$OPr-n	CH(Et)O(CH$_2$)$_2$Cl
CH(Et)OBu-i	CH(Me)CH$_2$OPr-i	CH(Et)O(CH$_2$)$_2$Br
CH(Et)OBu-s	CH(Me)CH$_2$OBu-n	C(Me)$_2$OCF$_2$H
CH(Et)OBu-t	CH(Me)CH$_2$OBu-i	C(Me)$_2$OCF$_3$
CH(Et)OPen-n	CH(Me)CH$_2$OBu-s	C(Me)$_2$OCH$_2$CF$_2$H
CH(Et)OPen-i	CH(Me)CH$_2$OBu-t	C(Me)$_2$OCH$_2$CF$_3$
CH(Et)OPen-s	CH(Et)CH$_2$OMe	C(Me)$_2$O(CH$_2$)$_2$CF$_3$
CH(Et)OPen-t	CH(Et)CH$_2$OEt	C(Me)$_2$O(CH$_2$)$_2$Cl
CH(Et)OHex-n	(CH$_2$)$_3$OMe	C(Me)$_2$O(CH$_2$)$_2$Br
CH(Pr-n)OMe	(CH$_2$)$_3$OEt	(CH$_2$)$_2$OCF$_3$
CH(Pr-n)OEt	(CH$_2$)$_3$OPr-n	(CH$_2$)$_2$OCH$_2$CF$_2$H
CH(Pr-n)OPr-n	(CH$_2$)$_3$OPr-i	(CH$_2$)$_2$OCH$_2$CF$_3$
CH(Pr-n)OPr-i	(CH$_2$)$_3$OBu-n	(CH$_2$)$_2$O(CH$_2$)$_2$Cl
CH(Pr-i)OMe	(CH$_2$)$_3$OBu-i	(CH$_2$)$_2$O(CH$_2$)$_2$Br
CH(Pr-i)OEt	(CH$_2$)$_3$OBu-s	CH$_2$OH
CH(Pr-i)OPr-n	(CH$_2$)$_3$OBu-t	CH(Me)OH
CH(Pr-i)OPr-i	CH$_2$OCF$_2$H	CH(Et)OH
C(Me)$_2$OMe	CH$_2$OCF$_3$	CH(iPr)OH
C(Me)$_2$OEt	CH$_2$OCH$_2$CF$_2$H	C(Me)$_2$OH
C(Me)$_2$OPr-n	CH$_2$OCH$_2$CF$_3$	(CH$_2$)$_2$OH
C(Me)$_2$OPr-i	CH$_2$O(CH$_2$)$_2$CF$_3$	CH(Me)CH$_2$OH

[表3]

R^{1a}
$(CH_2)_3OH$
CH_2OCH_2OMe
CH_2OCH_2OEt
CH_2OCH_2OPr-n
CH_2OCH_2OPr-i
$CH_2O(CH_2)_2OMe$
$CH_2O(CH_2)_2OEt$
$CH_2O(CH_2)_2OPr$-n
$CH_2O(CH_2)_2OPr$-i
$CH_2OCH(Me)CH_2OMe$
$CH_2OCH(Me)CH_2OEt$
$CH_2OCH_2CH(Me)OMe$
$CH_2OCH_2CH(Me)OEt$
$CH_2OCH(Me)OMe$
$CH_2OCH(Me)OEt$
$CH_2O(CH_2)_3OMe$
$CH_2O(CH_2)_3OEt$
$CH(Me)OCH_2OMe$
$CH(Me)OCH_2OEt$
$CH(Me)OCH_2OPr$-n
$CH(Me)OCH_2OPr$-i
$CH(Me)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Me)O(CH_2)_2OEt$
$CH(Me)O(CH_2)_2OPr$-n
$CH(Me)O(CH_2)_2OPr$-i
$CH(Me)OCH(Me)CH_2OMe$
$CH(Me)OCH(Me)CH_2OEt$
$CH(Me)OCH_2CH(Me)OMe$
$CH(Me)OCH_2CH(Me)OEt$
$C(Me)_2OCH_2OMe$
$C(Me)_2OCH_2OEt$
$C(Me)_2OCH_2OPr$-n
$C(Me)_2OCH_2OPr$-i
$C(Me)_2O(CH_2)_2OMe$
$C(Me)_2O(CH_2)_2OEt$

R^{1a}
$C(Me)_2O(CH_2)_2OPr$-n
$C(Me)_2O(CH_2)_2OPr$-i
$(CH_2)_2OCH_2OMe$
$(CH_2)_2OCH_2OEt$
$(CH_2)_2OCH_2OPr$-n
$(CH_2)_2OCH_2OPr$-i
$(CH_2)_2O(CH_2)_2OMe$
$(CH_2)_2O(CH_2)_2OEt$
$(CH_2)_2O(CH_2)_2OPr$-n
$(CH_2)_2O(CH_2)_2OPr$-i
$CH(Me)CH_2OCH_2OMe$
$CH(Me)CH_2OCH_2OEt$
$CH(Me)CH_2O(CH_2)_2OMe$
$CH(Me)CH_2O(CH_2)_2OEt$
$CH(Et)CH_2OCH_2OMe$
$CH(Et)CH_2OCH_2OEt$
$CH(Et)CH_2O(CH_2)_2OMe$
$CH(Et)CH_2O(CH_2)_2OEt$
$CH(Et)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Et)O(CH_2)_2OEt$
$CH(Et)O(CH_2)_2OPr$-n
$CH(Et)O(CH_2)_2OPr$-i
$CH(Pr$-n$)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Pr$-n$)O(CH_2)_2OEt$
$CH(Pr$-n$)O(CH_2)_2OPr$-n
$CH(Pr$-n$)O(CH_2)_2OPr$-i
$CH(Pr$-i$)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Pr$-i$)O(CH_2)_2OEt$
$CH(Pr$-i$)O(CH_2)_2OPr$-n
$CH(Pr$-i$)O(CH_2)_2OPr$-i
$CH_2OC(O)Me$
$CH_2OC(O)Et$
$CH_2OC(O)Pr$-i
$CH(Me)OC(O)Me$
$CH(Me)OC(O)Et$

R^{1a}
$CH(Me)OC(O)Pr$-i
$CH(Et)OC(O)Me$
$CH(Et)OC(O)Et$
$CH(Et)OC(O)Pr$-i
CH_2OPh
$CH(Me)OPh$
$CH_2C(O)OH$
$CH_2C(O)OMe$
$CH_2C(O)OEt$
$CH_2C(O)OPr$-n
$CH_2C(O)OPr$-i
$CH_2C(O)OBu$-n
$CH_2C(O)OBu$-i
$CH_2C(O)OBu$-s
$CH_2C(O)OBu$-t
$CH_2C(O)OPen$-n
$CH_2C(O)OPen$-i
$CH_2C(O)OPen$-s
$CH_2C(O)OPen$-t
$CH_2C(O)OHex$-n
$CH_2C(O)OCH_2OMe$
$CH_2C(O)O(CH_2)_2OMe$
$CH_2C(O)O(CH_2)_2OEt$
$CH_2C(O)O(CH_2)_2OPr$-i
$CH_2C(O)NHMe$
$CH_2C(O)NHEt$
$CH_2C(O)NHPr$-n
$CH_2C(O)NHPr$-i
$CH(Me)C(O)OH$
$CH(Me)C(O)OMe$
$CH(Me)C(O)OEt$
$CH(Me)C(O)OPr$-i
$CH(Me)C(O)OCH_2OMe$
$CH(Me)C(O)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Me)C(O)O(CH_2)_2OEt$

[表4]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
CH(Me)C(O)O(CH$_2$)$_2$OPr-i	CH$_2$S(O)$_2$Pr-i	CH(Me)SPr-i
CH(Me)C(O)NHMe	CH$_2$SBu-n	CH(Me)S(O)Pr-i
CH(Me)C(O)NHEt	CH$_2$S(O)Bu-n	CH(Me)S(O)$_2$Pr-i
CH(Me)C(O)NHPr-n	CH$_2$S(O)$_2$Bu-n	CH(Me)SBu-n
CH(Me)C(O)NHPr-i	CH$_2$SBu-i	CH(Me)S(O)Bu-n
CH(Et)C(O)OH	CH$_2$S(O)Bu-i	CH(Me)S(O)$_2$Bu-n
CH(Et)C(O)OMe	CH$_2$S(O)$_2$Bu-i	CH(Me)SBu-i
CH(Et)C(O)OEt	CH$_2$SBu-s	CH(Me)S(O)Bu-i
CH(Et)C(O)OPr-i	CH$_2$S(O)Bu-s	CH(Me)S(O)$_2$Bu-i
CH(Et)C(O)OCH$_2$OMe	CH$_2$S(O)$_2$Bu-s	CH(Me)SBu-s
CH(Et)C(O)O(CH$_2$)$_2$OMe	CH$_2$SBu-t	CH(Me)S(O)Bu-s
CH(Et)C(O)O(CH$_2$)$_2$OEt	CH$_2$S(O)Bu-t	CH(Me)S(O)$_2$Bu-s
CH(Et)C(O)O(CH$_2$)$_2$OPr-i	CH$_2$S(O)$_2$Bu-t	CH(Me)SBu-t
CH(Et)C(O)NHMe	CH$_2$SPen-n	CH(Me)S(O)Bu-t
CH(Et)C(O)NHEt	CH$_2$S(O)Pen-n	CH(Me)S(O)$_2$Bu-t
(CH$_2$)$_2$C(O)OH	CH$_2$S(O)$_2$Pen-n	CH(Me)SPen-n
(CH$_2$)$_2$C(O)OMe	CH$_2$SPen-i	CH(Me)S(O)Pen-n
(CH$_2$)$_2$C(O)OEt	CH$_2$S(O)Pen-i	CH(Me)S(O)$_2$Pen-n
(CH$_2$)$_2$C(O)O(CH$_2$)$_2$OMe	CH$_2$S(O)$_2$Pen-i	CH(Me)SPen-i
(CH$_2$)$_2$C(O)O(CH$_2$)$_2$OEt	CH$_2$SPen-s	CH(Me)S(O)Pen-i
(CH$_2$)$_2$C(O)NHMe	CH$_2$S(O)Pen-s	CH(Me)S(O)$_2$Pen-i
(CH$_2$)$_2$C(O)NHEt	CH$_2$S(O)$_2$Pen-s	CH(Me)SPen-s
(CH$_2$)$_2$C(O)NHPr-n	CH$_2$SPen-t	CH(Me)S(O)Pen-s
(CH$_2$)$_2$C(O)NHPr-i	CH$_2$S(O)Pen-t	CH(Me)S(O)$_2$Pen-s
CH$_2$SMe	CH$_2$S(O)$_2$Pen-t	CH(Me)SPen-t
CH$_2$S(O)Me	CH$_2$SHex-n	CH(Me)S(O)Pen-t
CH$_2$S(O)$_2$Me	CH(Me)SMe	CH(Me)S(O)$_2$Pen-t
CH$_2$SEt	CH(Me)S(O)Me	CH(Me)SHex-n
CH$_2$S(O)Et	CH(Me)S(O)$_2$Me	C(Me)$_2$SMe
CH$_2$S(O)$_2$Et	CH(Me)SEt	C(Me)$_2$S(O)Me
CH$_2$SPr-n	CH(Me)S(O)Et	C(Me)$_2$S(O)$_2$Me
CH$_2$S(O)Pr-n	CH(Me)S(O)$_2$Et	C(Me)$_2$SEt
CH$_2$S(O)$_2$Pr-n	CH(Me)SPr-n	C(Me)$_2$S(O)Et
CH$_2$SPr-i	CH(Me)S(O)Pr-n	C(Me)$_2$S(O)$_2$Et
CH$_2$S(O)Pr-i	CH(Me)S(O)$_2$Pr-n	C(Me)$_2$SPr-n

[表5]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
C(Me)$_2$S(O)Pr-n	(CH$_2$)$_2$SPr-n	C(Me)$_2$CH$_2$S(O)$_2$Et
C(Me)$_2$S(O)$_2$Pr-n	(CH$_2$)$_2$S(O)Pr-n	C(Me)$_2$CH$_2$SPr-n
C(Me)$_2$SPr-i	(CH$_2$)$_2$S(O)$_2$Pr-n	C(Me)$_2$CH$_2$S(O)Pr-n
C(Me)$_2$S(O)Pr-i	(CH$_2$)$_2$SPr-i	C(Me)$_2$CH$_2$S(O)$_2$Pr-n
C(Me)$_2$S(O)$_2$Pr-i	(CH$_2$)$_2$S(O)Pr-i	C(Me)$_2$CH$_2$SPr-i
C(Me)$_2$SBu-n	(CH$_2$)$_2$S(O)$_2$Pr-i	C(Me)$_2$CH$_2$S(O)Pr-i
C(Me)$_2$S(O)Bu-n	(CH$_2$)$_3$SMe	C(Me)$_2$CH$_2$S(O)$_2$Pr-i
C(Me)$_2$S(O)$_2$Bu-n	(CH$_2$)$_3$(O)Me	CH(Et)SMe
C(Me)$_2$SBu-i	(CH$_2$)$_3$S(O)$_2$Me	CH(Et)S(O)Me
C(Me)$_2$S(O)Bu-i	(CH$_2$)$_3$SEt	CH(Et)S(O)$_2$Me
C(Me)$_2$S(O)$_2$Bu-i	(CH$_2$)$_3$S(O)Et	CH(Et)SEt
C(Me)$_2$SBu-s	(CH$_2$)$_3$S(O)$_2$Et	CH(Et)S(O)Et
C(Me)$_2$S(O)Bu-s	CH(Me)CH$_2$SMe	CH(Et)S(O)$_2$Et
C(Me)$_2$S(O)$_2$Bu-s	CH(Me)CH$_2$S(O)Me	CH(Et)SPr-n
C(Me)$_2$SBu-t	CH(Me)CH$_2$S(O)$_2$Me	CH(Et)S(O)Pr-n
C(Me)$_2$S(O)Bu-t	CH(Me)CH$_2$SEt	CH(Et)S(O)$_2$Pr-n
C(Me)$_2$S(O)$_2$Bu-t	CH(Me)CH$_2$S(O)Et	CH(Et)SPr-i
C(Me)$_2$SPen-n	CH(Me)CH$_2$S(O)$_2$Et	CH(Et)S(O)Pr-i
C(Me)$_2$S(O)Pen-n	CH(Me)CH$_2$SPr-n	CH(Et)S(O)$_2$Pr-i
C(Me)$_2$S(O)$_2$Pen-n	CH(Me)CH$_2$S(O)Pr-n	CH(Pr-n)SMe
C(Me)$_2$SPen-i	CH(Me)CH$_2$S(O)$_2$Pr-n	CH(Pr-n)S(O)Me
C(Me)$_2$S(O)Pen-i	CH(Me)CH$_2$SPr-i	CH(Pr-n)S(O)$_2$Me
C(Me)$_2$S(O)$_2$Pen-	CH(Me)CH$_2$S(O)Pr-i	CH(Pr-n)SEt
C(Me)$_2$SPen-s	CH(Me)CH$_2$S(O)$_2$Pr-i	CH(Pr-n)S(O)Et
C(Me)$_2$S(O)Pen-s	CH(Et)CH$_2$SMe	CH(Pr-n)S(O)$_2$Et
C(Me)$_2$S(O)$_2$Pen-s	CH(Et)CH$_2$S(O)Me	CH(Pr-n)SPr-n
C(Me)$_2$SPen-t	CH(Et)CH$_2$S(O)$_2$Me	CH(Pr-n)S(O)Pr-n
C(Me)$_2$S(O)Pen-t	CH(Et)CH$_2$SEt	CH(Pr-n)S(O)$_2$Pr-n
C(Me)$_2$S(O)$_2$Pen-t	CH(Et)CH$_2$S(O)Et	CH(Pr-n)SPr-i
(CH$_2$)$_2$SMe	CH(Et)CH$_2$S(O)$_2$Et	CH(Pr-n)S(O)Pr-i
(CH$_2$)$_2$S(O)Me	C(Me)$_2$CH$_2$SMe	CH(Pr-n)S(O)$_2$Pr-i
(CH$_2$)$_2$S(O)$_2$Me	C(Me)$_2$CH$_2$S(O)Me	CH(Pr-i)SMe
(CH$_2$)$_2$SEt	C(Me)$_2$CH$_2$S(O)$_2$Me	CH(Pr-i)S(O)Me
(CH$_2$)$_2$S(O)Et	C(Me)$_2$CH$_2$SEt	CH(Pr-i)S(O)$_2$Me
(CH$_2$)$_2$S(O)$_2$Et	C(Me)$_2$CH$_2$S(O)Et	CH(Pr-i)SEt

[表6]

R^{1e}	R^{1a}	R^{1a}
CH(Pr-i)S(O)Et	$CH_2SCF(CF_3)_2$	$C(Me)_2S(O)(CH_2)_2CF_3$
CH(Pr-i)$S(O)_2$Et	$CH(Me)SCF_2H$	$C(Me)_2S(O)_2(CH_2)_2CF_3$
CH(Pr-i)SPr-n	$CH(Me)S(O)CF_2H$	$C(Me)_2S(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-i)S(O)Pr-n	$CH(Me)S(O)_2CF_2H$	$C(Me)_2S(O)(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-i)$S(O)_2$Pr-n	$CH(Me)SCF_3$	$C(Me)_2S(O)_2(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-i)SPr-i	$CH(Me)S(O)CF_3$	$C(Me)_2S(CH_2)_2Br$
CH(Pr-i)S(O)Pr-i	$CH(Me)S(O)_2CF_3$	$C(Me)_2S(O)(CH_2)_2Br$
CH(Pr-i)$S(O)_2$Pr-i	$CH(Me)SCH_2CF_2H$	$C(Me)_2S(O)_2(CH_2)_2Br$
CH_2SCF_2H	$CH(Me)S(O)CH_2CF_2H$	$(CH_2)_2SCF_3$
$CH_2S(O)CF_2H$	$CH(Me)S(O)_2CH_2CF_2H$	$(CH_2)_2S(O)CF_3$
$CH_2S(O)_2CF_2H$	$CH(Me)SCH_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)_2CF_3$
CH_2SCF_3	$CH(Me)S(O)CH_2CF_3$	$(CH_2)_2SCH_2CF_2H$
$CH_2S(O)CF_3$	$CH(Me)S(O)_2CH_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)CH_2CF_2H$
$CH_2S(O)_2CF_3$	$CH(Me)S(CH_2)_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)_2CH_2CF_2H$
$CH_2SCH_2CF_2H$	$CH(Me)S(O)(CH_2)_2CF_3$	$(CH_2)_2SCH_2CF_3$
$CH_2S(O)CH_2CF_2H$	$CH(Me)S(O)_2(CH_2)_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)CH_2CF_3$
$CH_2S(O)_2CH_2CF_2H$	$CH(Me)S(CH_2)_2Cl$	$(CH_2)_2S(O)_2CH_2CF_3$
$CH_2SCH_2CF_3$	$CH(Me)S(O)(CH_2)_2Cl$	$(CH_2)_2S(CH_2)_2Cl$
$CH_2S(O)CH_2CF_3$	$CH(Me)S(O)_2(CH_2)_2Cl$	$(CH_2)_2S(O)(CH_2)_2Cl$
$CH_2S(O)_2CH_2CF_3$	$CH(Me)S(CH_2)_2Br$	$(CH_2)_2S(O)_2(CH_2)_2Cl$
$CH_2S(CH_2)_2CF_3$	$CH(Me)S(O)(CH_2)_2Br$	$(CH_2)_2S(CH_2)_2Br$
$CH_2S(O)(CH_2)_2CF_3$	$CH(Me)S(O)_2(CH_2)_2Br$	$(CH_2)_2S(O)(CH_2)_2Br$
$CH_2S(O)_2(CH_2)_2CF_3$	$C(Me)_2SCF_2H$	$(CH_2)_2S(O)_2(CH_2)_2Br$
$CH_2S(CH_2)_2Cl$	$C(Me)_2S(O)CF_2H$	$CH=CH_2$
$CH_2S(O)(CH_2)_2Cl$	$C(Me)_2S(O)_2CF_2H$	CH=CHMe
$CH_2S(O)_2(CH_2)_2Cl$	$C(Me)_2SCF_3$	$CH=CMe_2$
$CH_2S(CH_2)_2Br$	$C(Me)_2S(O)CF_3$	$CH_2CH=CH_2$
$CH_2S(O)(CH_2)_2Br$	$C(Me)_2S(O)_2CF_3$	$CH_2CH=CHMe$
$CH_2S(O)_2(CH_2)_2Br$	$C(Me)_2SCH_2CF_2H$	$CH_2C(Me)=CH_2$
$CH_2SCHFCH_3$	$C(Me)_2S(O)CH_2CF_2H$	$(CH_2)_2CH=CMe_2$
$CH_2SCF_2CH_3$	$C(Me)_2S(O)_2CH_2CF_2H$	$C(Me)=CH_2$
$CH_2SCF(CH_3)_2$	$C(Me)_2SCH_2CF_3$	C(Me)=CHMe
$CH_2SCH_2CF_2H$	$C(Me)_2S(O)CH_2CF_3$	$C(Me)=CMe_2$
$CH_2SCF_2CF_3$	$C(Me)_2S(O)_2CH_2CF_3$	$CH(Me)CH=CH_2$
$CH_2SCF_2CF_2CF_3$	$C(Me)_2S(CH_2)_2CF_3$	$C(Et)=CH_2$

[表7]

R^{3a}	R^{3a}	R^{3a}
C(Et)=CHMe	2,4-$(Cl)_2$-Ph	3-F-4-Cl-Ph
C(Et)=CMe_2	2,5-$(Cl)_2$-Ph	3-F-5-Cl-Ph
CH(Et)CH=CH_2	2,6-$(Cl)_2$-Ph	2-Me-3-F-Ph
C≡CH	3,4-$(Cl)_2$-Ph	2-Me-4-F-Ph
C≡CMe	3,5-$(Cl)_2$-Ph	2-Me-5-F-Ph
CH_2C≡CH	2,3-$(Me)_2$-Ph	3-Me-4-F-Ph
CH_2C≡CMe	2,4-$(Me)_2$-Ph	3-Me-5-F-Ph
CH(Me)C≡CH	2,5-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-3-MeO-Ph
CH(Me)C≡CMe	2,6-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-4-MeO-Ph
Ph	3,4-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-5-MeO-Ph
2-F-Ph	3,5-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-6-MeO-Ph
3-F-Ph	2,3-$(MeO)_2$-Ph	3-Cl-4-MeO-Ph
4-F-Ph	2,4-$(MeO)_2$-Ph	3-Cl-5-MeO-Ph
2-Cl-Ph	2,5-$(MeO)_2$-Ph	2-F-3-MeO-Ph
3-Cl-Ph	2,6-$(MeO)_2$-Ph	2-F-4-MeO-Ph
4-Cl-Ph	3,4-$(MeO)_2$-Ph	2-F-5-MeO-Ph
2-Br-Ph	3,5-$(MeO)_2$-Ph	2-F-6-MeO-Ph
3-Br-Ph	2-Cl-3-Me-Ph	3-F-4-MeO-Ph
4-Br-Ph	2-Cl-4-Me-Ph	3-F-5-MeO-Ph
2-Me-Ph	2-Cl-5-Me-Ph	2-MeO-3-F-Ph
3-Me-Ph	3-Cl-4-Me-Ph	2-MeO-4-F-Ph
4-Me-Ph	3-Cl-5-Me-Ph	2-MeO-5-F-Ph
2-CF_3-Ph	2-Cl-3-F-Ph	2-MeO-6-F-Ph
3-CF_3-Ph	2-Cl-4-F-Ph	3-MeO-4-F-Ph
4-CF_3-Ph	2-Cl-5-F-Ph	3-MeO-5-F-Ph
2-MeO-Ph	3-Cl-4-F-Ph	2-MeO-3-Cl-Ph
3-MeO-Ph	3-Cl-5-F-Ph	2-MeO-4-Cl-Ph
4-MeO-Ph	2-F-3-Me-Ph	2-MeO-5-Cl-Ph
2,3-$(F)_2$-Ph	2-F-4-Me-Ph	2-MeO-6-Cl-Ph
2,4-$(F)_2$-Ph	2-F-5-Me-Ph	3-MeO-4-Cl-Ph
2,5-$(F)_2$-Ph	3-F-4-Me-Ph	3-MeO-5-Cl-Ph
2,6-$(F)_2$-Ph	3-F-5-Me-Ph	2-Me-3-MeO-Ph
3,4-$(F)_2$-Ph	2-F-3-Cl-Ph	2-Me-4-MeO-Ph
3,5-$(F)_2$-Ph	2-F-4-Cl-Ph	2-Me-5-MeO-Ph
2,3-$(Cl)_2$-Ph	2-F-5-Cl-Ph	2-Me-6-MeO-Ph

[表8]

R^{1a}	R^{2a}	R^{1b}
3-Me-4-MeO-Ph	D-11	CH_2(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
3-Me-5-MeO-Ph	D-12	CH_2(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-3-Me-Ph	D-13a	CH_2(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-4-Me-Ph	D-14	CH_2(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-5-Me-Ph	D-16	CH(Me)(2-MeO-Ph)
2-MeO-6-Me-Ph	D-16a	CH(Me)(3-MeO-Ph)
3-MeO-4-Me-Ph	D-16b	CH(Me)(4-MeO-Ph)
3-MeO-5-Me-Ph	D-16c	CH(Me)(2,3-$(MeO)_2$-Ph)
3,5-$(F)_2$-4-Me-Ph	D-16d	CH(Me)(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
3,5-$(F)_2$-4-MeO-Ph	D-16e	CH(Me)(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
3,4,5-$(MeO)_3$-Ph	D-16f	CH(Me)(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
D-3	D-16g	CH(Me)(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
D-3a	D-16h	CH(Me)(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
D-4	D-16i	CH(Et)(2-MeO-Ph)
D-4a	D-16j	CH(Et)(3-MeO-Ph)
D-4b	D-16k	CH(Et)(4-MeO-Ph)
D-8	D-16m	$(CH_2)_2$(2-MeO-Ph)
D-8a	D-16n	$(CH_2)_2$(3-MeO-Ph)
D-8b	D-16p	$(CH_2)_2$(4-MeO-Ph)
D-8c	D-17	CHO
D-8d	D-17a	CH=NOMe
D-8e	D-17b	OMe
D-8f	D-19	OEt
D-8g	D-24a	OPr-n
D-8h	D-24b	OPr-i
D-9	D-24c	OBu-n
D-9a	D-24d	OBu-i
D-9c	D-24e	OBu-s
D-9d	D-24f	OBu-t
D-9f	CH_2Ph	OPen-n
D-9g	CH_2(2-MeO-Ph)	OPen-i
D-9i	CH_2(3-MeO-Ph)	OPen-s
D-9j	CH_2(4-MeO-Ph)	OPen-t
D-9m	CH_2(2,3-$(MeO)_2$-Ph)	OHex-n
D-10a	CH_2(2,4-$(MeO)_2$-Ph)	SMe

[表9]

R^{1w}	R^{1w}	R^{1w}
S(O)Me	SPen-n	$S(CH_2)_2Cl$
$S(O)_2Me$	S(O)Pen-n	$S(O)(CH_2)_2C$
SEt	$S(O)_2Pen-n$	$S(O)_2(CH_2)_2Cl$
S(O)Et	SPen-i	$SCH(Me)CH_2Cl$
$S(O)_2Et$	S(O)Pen-i	$SCH_2CH(Me)Cl$
SPr-n	$S(O)_2Pen-i$	$S(CH_2)_3Cl$
S(O)Pr-n	SPen-c	SCF_3
$S(O)_2Pr-n$	S(O)Pen-c	SCH_2CF_3
SPr-i	$S(O)_2Pen-c$	$S(O)CH_2CF_3$
S(O)Pr-i	SPen-s	$S(O)_2CH_2CF_3$
$S(O)_2Pr-i$	S(O)Pen-s	$SCH(Me)CF_3$
SPr-c	$S(O)_2Pen-s$	$S(CH_2)_2CF_3$
S(O)Pr-c	SPen-t	$S(CH_2)_3CF_3$
$S(O)_2Pr-c$	S(O)Pen-t	$SCHFCH_3$
S(D-16)	$S(O)_2Pen-t$	SCF_2CH_3
S(O)(D-16)	SHex-n	$SCF(CH_3)_2$
$S(O)_2(D-16)$	SHex-c	SCF_2CF_2H
S(D-16e)	$SCH_2CH=CH_2$	SCF_2CF_3
S(O)(D-16e)	$S(O)CH_2CH=CH_2$	$SCF_2CF_2CF_3$
$S(O)_2(D-16e)$	$S(O)_2CH_2CH=CH_2$	$SCF(CF_3)_2$
SBu-n	$SCH(Me)CH=CH_2$	SCH_2OMe
S(O)Bu-n	$SC(Me)_2CH=CH_2$	$S(CH_2)_2OMe$
$S(O)_2Bu-n$	$SCH_2CH=CHMe$	$S(O)(CH_2)_2OMe$
SBu-i	$SCH_2C(Me)=CH_2$	$S(O)_2(CH_2)_2OMe$
S(O)Bu-i	$S(CH_2)_2CH=CMe_2$	$SCH(Me)CH_2OMe$
$S(O)_2Bu-i$	$SC(Me)=CH_2$	$S(O)CH(Me)CH_2OMe$
SBu-c	SC(Me)=CH(Me)	$S(O)_2CH(Me)CH_2OMe$
S(O)Bu-c	$SCH_2C\equiv CH$	$SCH_2CH(Me)OMe$
$S(O)_2Bu-c$	$S(O)CH_2C\equiv CH$	$S(O)CH_2CH(Me)OMe$
SBu-s	$S(O)_2CH_2C\equiv CH$	$S(O)_2CH_2CH(Me)OMe$
S(O)Bu-s	$SCH(Me)C\equiv CH$	$SC(Me)_2CH_2OMe$
$S(O)_2Bu-s$	$SC(Me)_2C\equiv CH$	$S(CH_2)_3OMe$
SBu-t	$SCH_2C\equiv CMe$	SCH_2OEt
S(O)Bu-t	SCH_2Cl	$S(CH_2)_2OEt$
$S(O)_2Bu-t$	SCH(Me)Cl	$S(O)(CH_2)_2OEt$

[表10]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$S(O)_2(CH_2)_2OEt$	$S(O)_2CH_2CN$	SCH(Me)C(O)Me
SCH(Me)CH_2OEt	SCH(Me)CN	$S(CH_2)_2C(O)Me$
SCH_2OPr-i	S(O)CH(Me)CN	$SCH_2C(O)OMe$
$S(CH_2)_2OPr$-i	$S(O)_2CH(Me)CN$	SCH(Me)C(O)OMe
$S(O)(CH_2)_2OPr$-i	$SC(Me)_2CN$	$S(CH_2)_2C(O)OMe$
$S(O)_2(CH_2)_2OPr$-i	$S(O)C(Me)_2CN$	$SCH_2C(O)OEt$
SCH(Me)CH_2OPr-i	$S(O)_2C(Me)_2CN$	SCH(Me)C(O)OEt
SCH_2Pr-c	$S(CH_2)_2CN$	$S(CH_2)_2C(O)OEt$
$S(O)CH_2Pr$-c	$S(O)(CH_2)_2CN$	SCH_2(D-8a)
$S(O)_2CH_2Pr$-c	$S(O)_2(CH_2)_2CN$	$S(O)CH_2$(D-8a)
SCH(Me)Pr-c	SCH_2Ph	$S(O)_2CH_2$(D-8a)
S(O)CH(Me)Pr-c	$S(O)CH_2Ph$	SCH_2(D-8b)
$S(O)_2CH(Me)Pr$-c	$S(O)_2CH_2Ph$	$S(O)CH_2$(D-8b)
$S(CH_2)_2Pr$-c	SCH(Me)Ph	$S(O)_2CH_2$(D-8b)
SCH_2(D-16)	S(O)CH(Me)Ph	SCH_2(D-8c)
$S(O)CH_2$(D-16)	$S(O)_2CH(Me)Ph$	$S(O)CH_2$(D-8c)
$S(O)_2CH_2$(D-16)	SCH_2(2-MeO-Ph)	$S(O)_2CH_2$(D-8c)
SCH_2(D-16e)	$S(O)CH_2$(2-MeO-Ph)	SCH_2(D-8d)
$S(O)CH_2$(D-16e)	$S(O)_2CH_2$(2-MeO-Ph)	$S(O)CH_2$(D-8d)
$S(O)_2CH_2$(D-16e)	SCH(Me)(2-MeO-Ph)	$S(O)_2CH_2$(D-8d)
SCH_2Bu-c	S(O)CH(Me)(2-MeO-Ph)	SCH_2(D-8e)
$S(O)CH_2Bu$-c	$S(O)_2CH(Me)(2-MeO-Ph)$	$S(O)_2CH_2$(D-8e)
$S(O)_2CH_2Bu$-c	SCH_2(3-MeO-Ph)	SCH_2(D-8f)
SCH(Me)Bu-c	$S(O)CH_2$(3-MeO-Ph)	$S(O)_2CH_2$(D-8f)
$S(CH_2)_2Bu$-c	$S(O)_2CH_2$(3-MeO-Ph)	SCH_2(D-8g)
SCH_2Pen-c	SCH(Me)(3-MeO-Ph)	$S(O)_2CH_2$(D-8g)
$S(O)CH_2Pen$-c	S(O)CH(Me)(3-MeO-Ph)	SCH_2(D-8h)
$S(O)_2CH_2Pen$-c	$S(O)_2CH(Me)(3-MeO-Ph)$	$S(O)_2CH_2$(D-8h)
SCH(Me)Pen-c	SCH_2(4-MeO-Ph)	SCH_2(D-15)
$S(CH_2)_2Pen$-c	$S(O)CH_2$(4-MeO-Ph)	$S(O)CH_2$(D-15)
SCH_2Hex-c	$S(O)_2CH_2$(4-MeO-Ph)	$S(O)_2CH_2$(D-15)
SCH(Me)Hex-c	SCH(Me)(4-MeO-Ph)	SCH(Me)(D-15)
$S(CH_2)_2Hex$-c	S(O)CH(Me)(4-MeO-Ph)	S(O)CH(Me)(D-15)
SCH_2CN	$S(O)_2CH(Me)(4\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$S(O)_2CH(Me)$(D-15)
$S(O)CH_2CN$	$SCH_2C(O)Me$	$S(CH_2)_2$(D-15)

[表11]

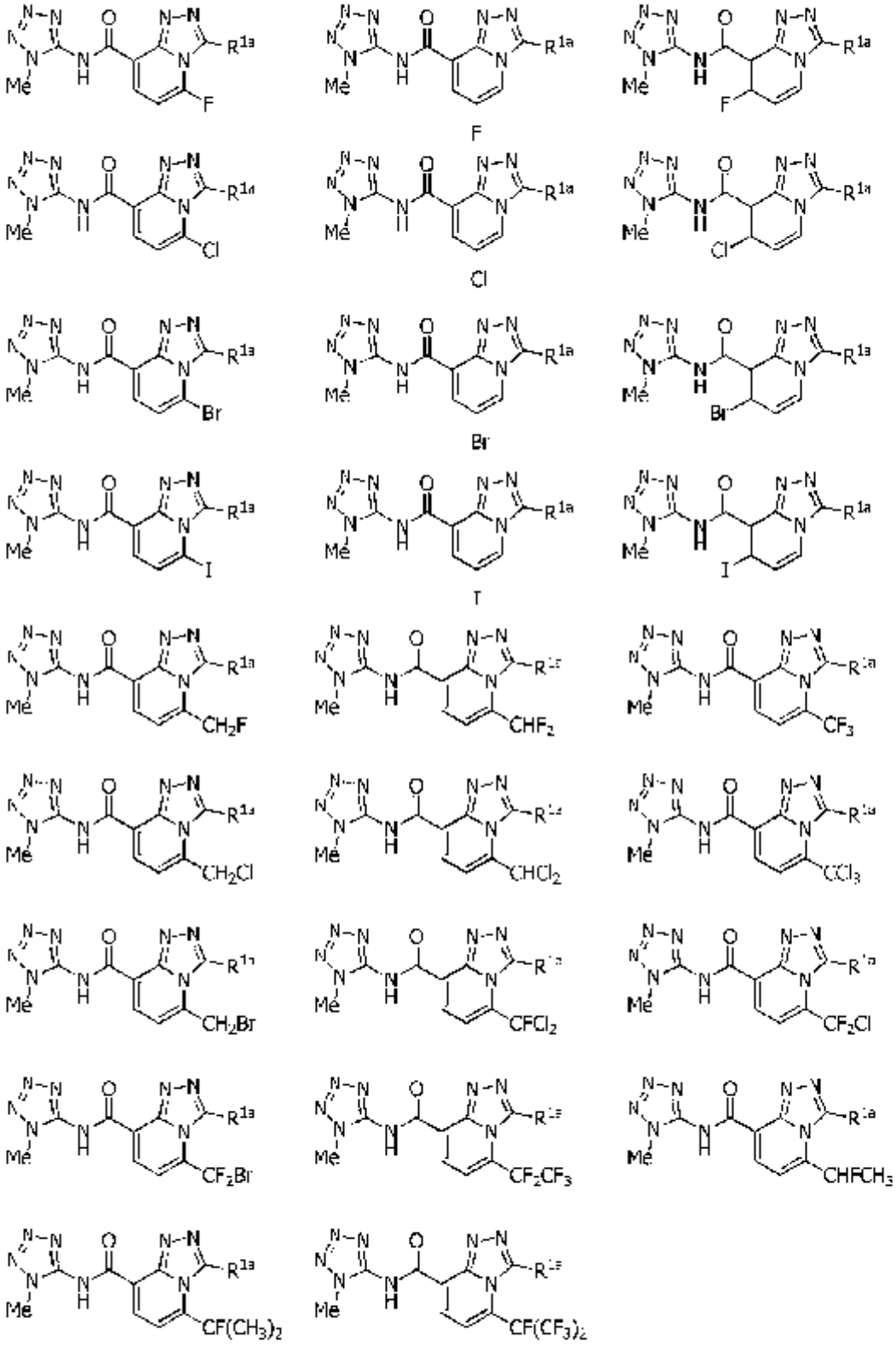
R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
S(O)$(CH_2)_2$(D-15)	N(Me)Pr-c	N(Pr-i)Pr-i
$S(O)_2(CH_2)_2$(D-15)	N(Me)(D-18)	N(Pr-i)Pr-c
SCH_2(D-18)	N(Me)(D-18c)	N(Pr-i)(D-18)
$S(O)CH_2$(D-18)	N(Me)Bu-n	N(Pr-i)(D-18e)
$S(O)_2CH_2$(D-18)	N(Me)Bu-i	N(Pr-i)Bu-n
SCH(Me)(D-18)	N(Me)Bu-c	N(Pr-i)Bu-i
S(O)CH(Me)(D-18)	N(Me)Bu-s	N(Pr-i)Bu-c
$S(O)_2$CH(Me)(D-18)	N(Me)Bu-t	N(Pr-i)Bu-s
$S(CH_2)_2$(D-18)	N(Me)Pen-n	$NHCH_2OMe$
S(O)$(CH_2)_2$(D-18)	N(Me)Pen-i	$NHCH_2OEt$
$S(O)_2(CH_2)_2$(D-18)	N(Me)Pen-c	NHCH(Me)OMe
NHMe	N(Me)Pen-s	NHCH(Me)OEt
NHEt	N(Me)Pen-t	$NHC(Me)_2OMe$
NHPr-n	N(Me)(3-Pen)	$NHC(Me)_2OEt$
NHPr-i	N(Me)Hex-n	$NH(CH_2)_2OMe$
NHPr-c	N(Me)Hex-c	$NH(CH_2)_2OEt$
NH(D-16)	N(Et)Et	$NH(CH_2)_2OPr-n$
NH(D-16e)	N(Et)Pr-n	$NH(CH_2)_2OPr-i$
NHBu-n	N(Et)Pr-i	$N(Me)CH_2OMe$
NHBu-i	N(Et)Pr-c	$N(Me)CH_2OEt$
NHBu-c	N(Et)(D-16)	N(Me)CH(Me)OMe
NHBu-s	N(Et)(D-16e)	N(Me)CH(Me)OEt
NHBu-t	N(Et)Bu-n	$N(Me)C(Me)_2OMe$
NHPen-n	N(Et)Bu-i	$N(Me)C(Me)_2OEt$
NHPen-i	N(Et)Bu-c	$N(Me)(CH_2)_2OMe$
NHPen-c	N(Et)Bu-s	$N(Me)(CH_2)_2OEt$
NHPen-s	N(Pr-n)Pr-n	$N(Me)(CH_2)_2OPr-n$
NHPen-t	N(Pr-n)Pr-i	$N(Me)(CH_2)_2OPr-$
NH(3-Pen)	N(Pr-n)Pr-c	$N(Et)C(Me)_2OMe$
NHHex-n	N(Pr-n)(D-16)	$N(Et)C(Me)_2OEt$
NHHex-c	N(Pr-n)(D-16e)	$N(Et)(CH_2)_2OMe$
N(Me)Me	N(Pr-n)Bu-n	$N(Et)(CH_2)_2OEt$
N(Me)Et	N(Pr-n)Bu-i	$N(Et)(CH_2)_2OPr-n$
N(Me)Pr-n	N(Pr-n)Bu-c	$N(Et)(CH_2)_2OPr-i$
N(Me)Pr-i	N(Pr-n)Bu-s	$N(Pr-n)(CH_2)_2OMe$

[表12]

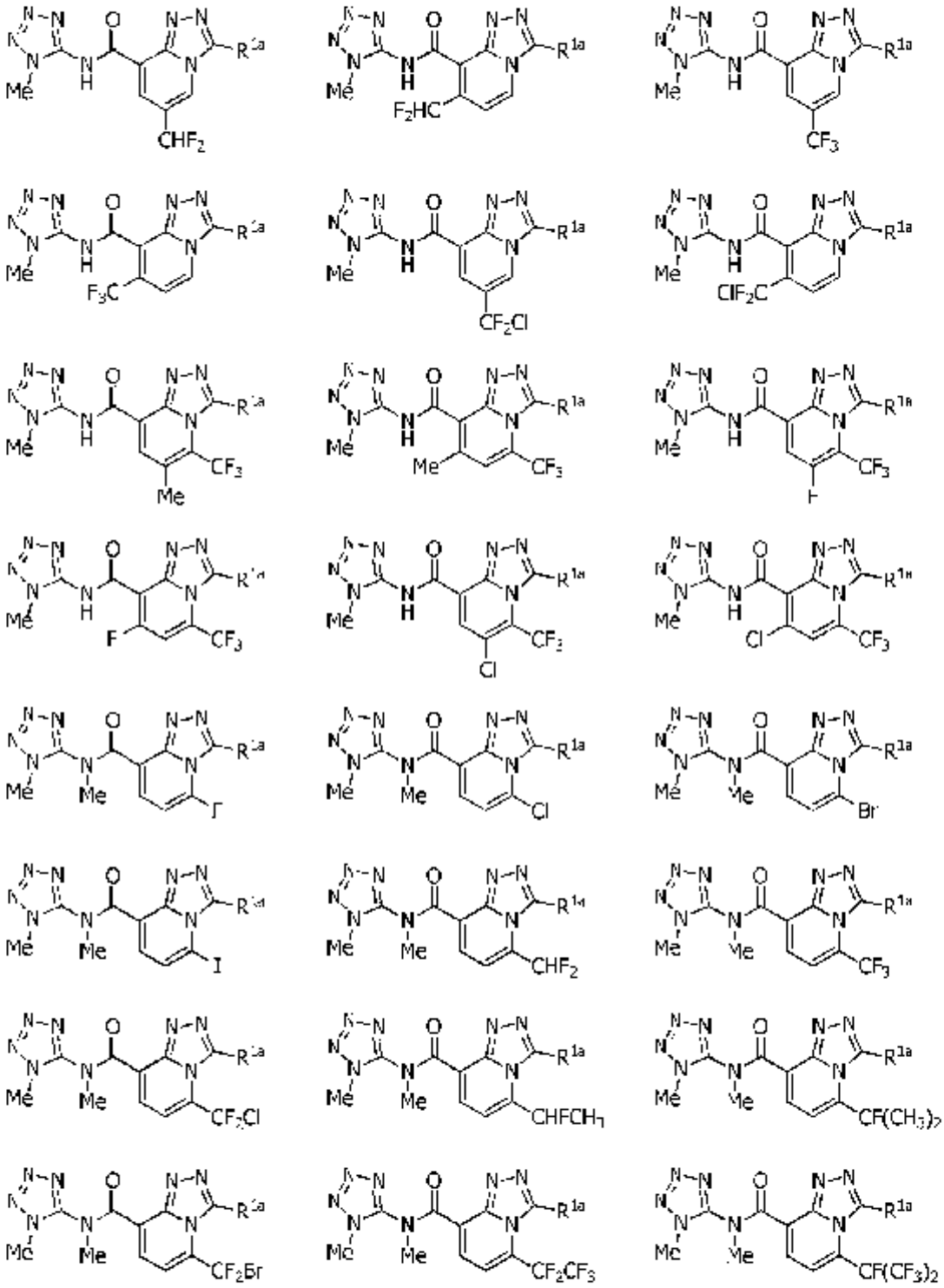
R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
N(Pr-n)$(CH_2)_2$OEt	N(Me)$(CH_2)_2$S(O)Pr-i	NH(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
N(Pr-n)$(CH_2)_2$OPr-n	N(Me)$(CH_2)_2$S$(O)_2$Pr-i	NH(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
N(Pr-n)$(CH_2)_2$OPr-i	$NHCF_2H$	NH(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
N(Pr-i)$(CH_2)_2$OMe	$NHCF_3$	N(Me)Ph
N(Pr-i)$(CH_2)_2$OEt	$NHCH_2CF_2H$	N(Me)(2-MeO-Ph)
N(Pr-i)$(CH_2)_2$OPr-n	$NHCH_2CF_3$	N(Me)(3-MeO-Ph)
N(Pr-i)$(CH_2)_2$OPr-i	$NH(CH_2)_2CF_3$	N(Me)(4-MeO-Ph)
$NHCH_2SMe$	$NH(CH_2)_2Cl$	N(Me)(2,3-$(MeO)_2$-Ph)
$NHCH_2SEt$	$NH(CH_2)_3Cl$	N(Me)(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
NHCH(Me)SMe	$N(Me)CF_2H$	N(Me)(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
NHCH(Me)SEt	$N(Me)CF_3$	N(Me)(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
$NHC(Me)_2SMe$	$N(Me)CH_2CF_2H$	N(Me)(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
$NHC(Me)_2SEt$	$N(Me)CH_2CF_3$	N(Me)(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
$NH(CH_2)_2SMe$	$N(Me)(CH_2)_2CF_3$	$NHCH_2Ph$
$NH(CH_2)_2S(O)Me$	$N(Me)(CH_2)_2Cl$	$NHCH_2$(2-MeO-Ph)
$NH(CH_2)_2S(O)_2Me$	$N(Me)(CH_2)_3Cl$	$NHCH_2$(3-MeO-Ph)
$NH(CH_2)_2SEt$	$NHCH_2CH=CH_2$	$NHCH_2$(4-MeO-Ph)
$NH(CH_2)_2S(O)Et$	$N(Me)CH_2CH=CH_2$	$N(Me)CH_2Ph$
$NH(CH_2)_2S(O)_2Et$	$NHCH_2C\equiv CH$	N(Me)CH_2(2-MeO-Ph)
$NH(CH_2)_2SPr-i$	$NHCH_2C\equiv CMe$	N(Me)CH_2(3-MeO-Ph)
$NH(CH_2)_2S(O)Pr-i$	$N(Me)CH_2C\equiv CH$	N(Me)CH_2(4-MeO-Ph)
$N(Me)CH_2SMe$	$N(Me)CH_2C\equiv CMe$	NH(D-9b)
$N(Me)CH_2SEt$	$NHCH_2CN$	NH(D-9c)
N(Me)CH(Me)SMe	$NH(CH_2)_2CN$	NH(D-9h)
N(Me)CH(Me)SEt	$NH(CH_2)_3CN$	NH(D-9k)
$N(Me)C(Me)_2SMe$	$N(Me)CH_2CN$	N(Me)(D-9b)
$N(Me)C(Me)_2SEt$	$N(Me)(CH_2)_2CN$	N(Me)(D-9e)
$N(Me)(CH_2)_2SMe$	$N(Me)(CH_2)_3CN$	N(Me)(D-9h)
$N(Me)(CH_2)_2S(O)Me$	NHPh	N(Me)(D-9k)
$N(Me)(CH_2)_2S(O)_2Me$	NH(2-MeO-Ph)	$NHSO_2Ph$
$N(Me)(CH_2)_2SEt$	NH(3-MeO-Ph)	$N(Me)SO_2Ph$
$N(Me)(CH_2)_2S(O)Et$	NH(4-MeO-Ph)	
$N(Me)(CH_2)_2S(O)_2Et$	NH(2,3-$(MeO)_2$-Ph)	
$N(Me)(CH_2)_2SPr-i$	NH(2,4-$(MeO)_2$-Ph)	
	NH(2,5-$(MeO)_2$-Ph)	

[0190] [第２表]

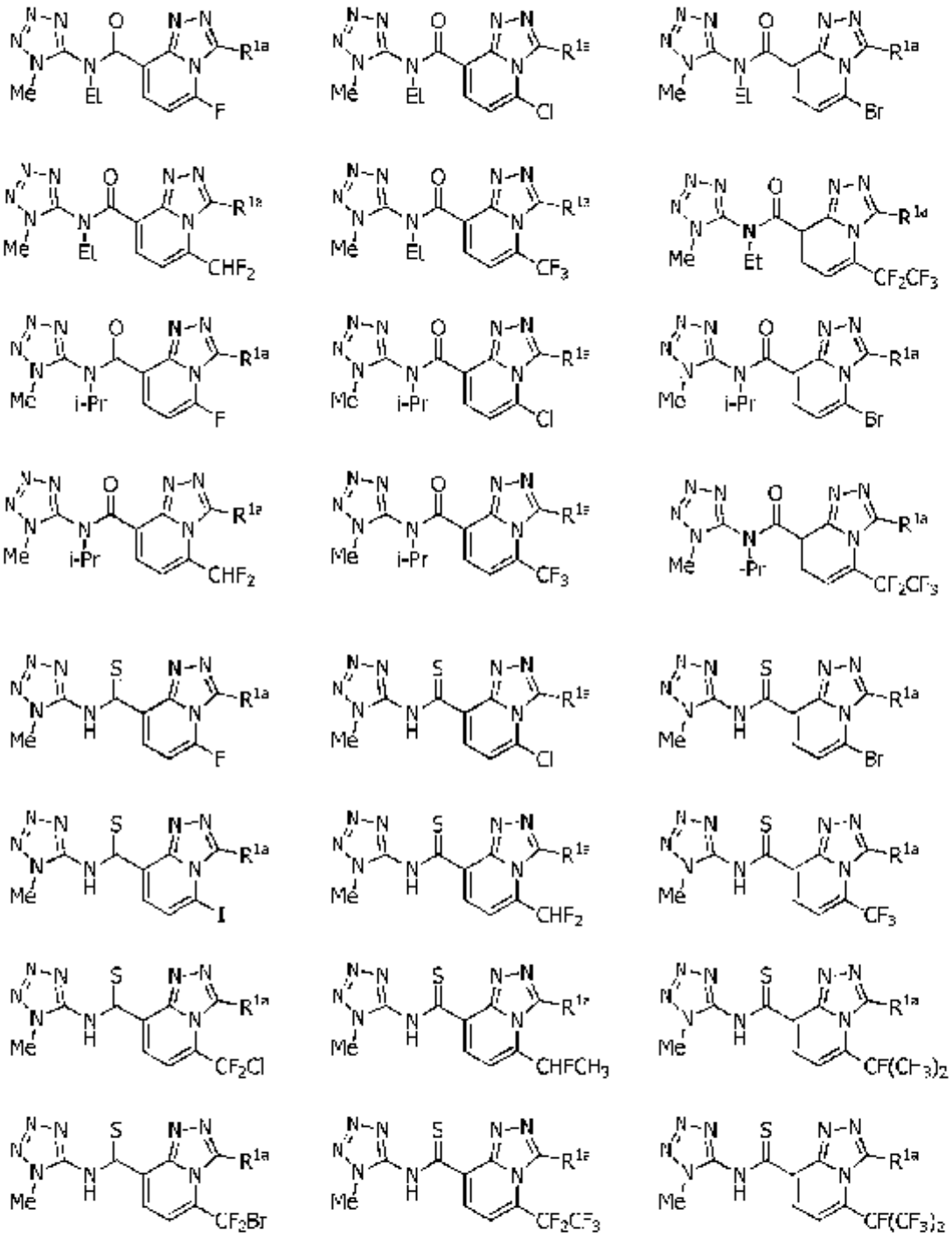
[化33]


F
Cl
Br
I
CH2F
CHF2
CF3
CH2Cl
CHCl2
CCl3
CH2Br
CFCl2
CF2Cl
CF2Br
CF2CF3
CHFCH3
CF(CH3)2
CF(CF3)2

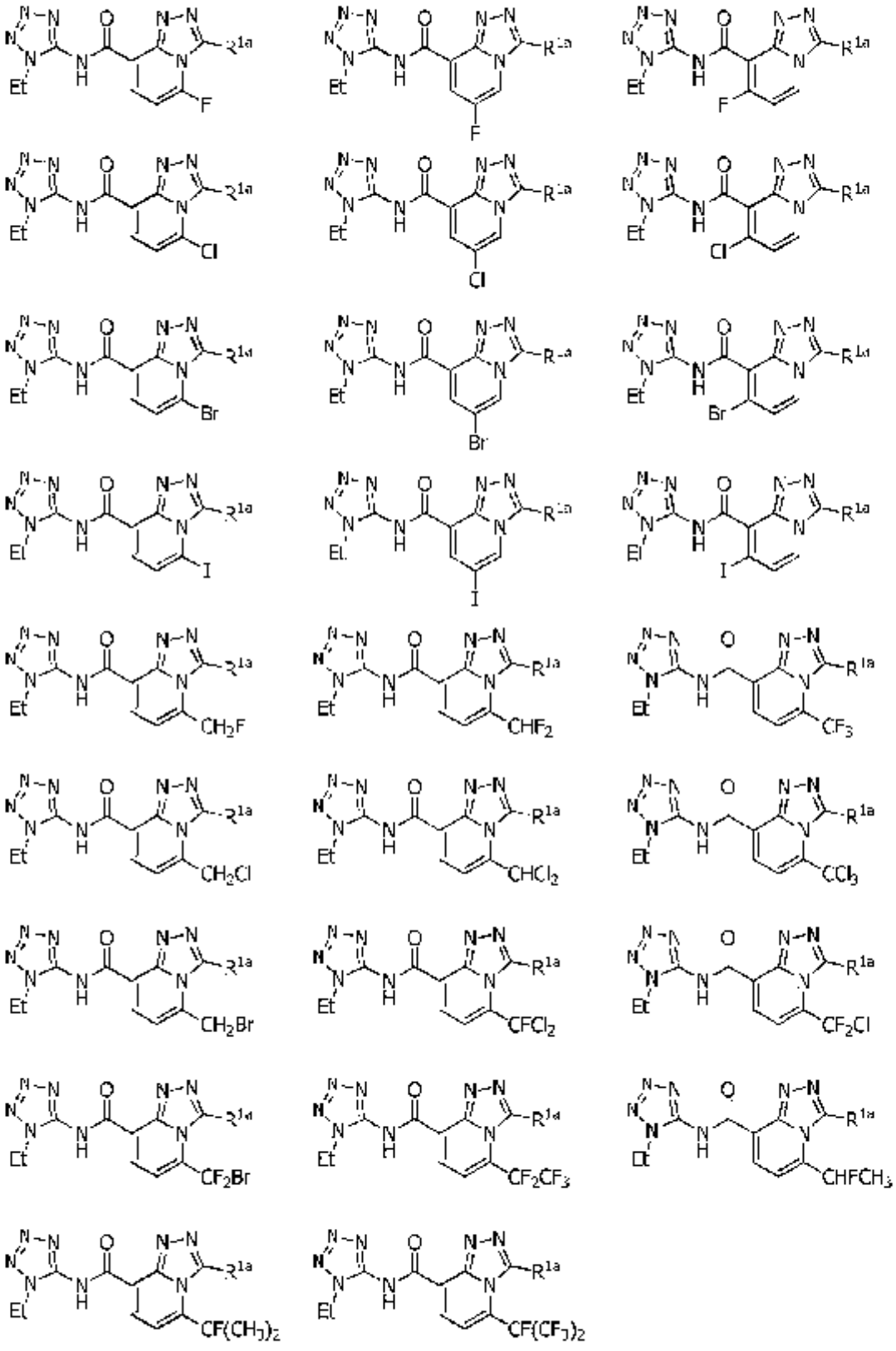
[化34]



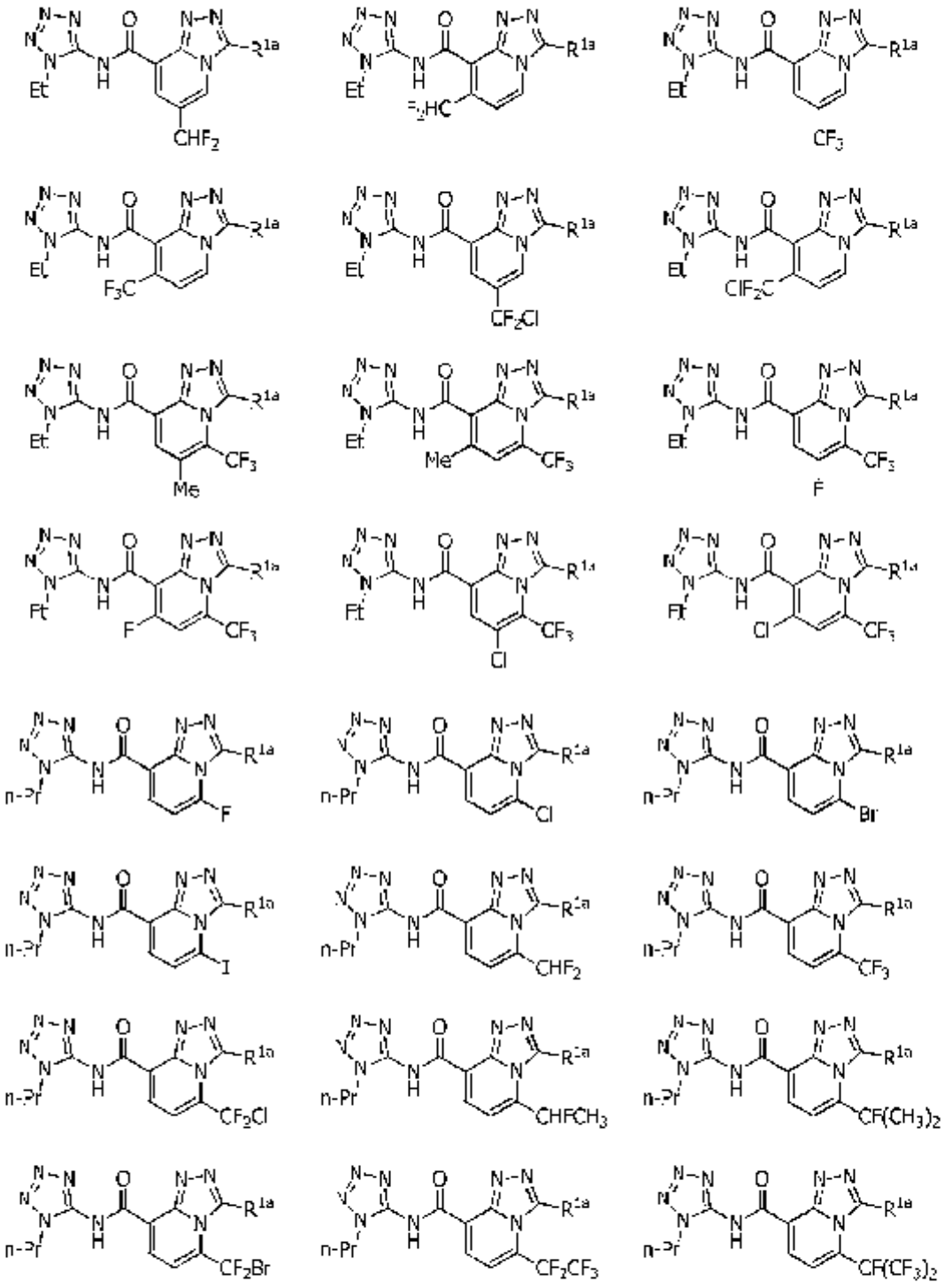
[化35]



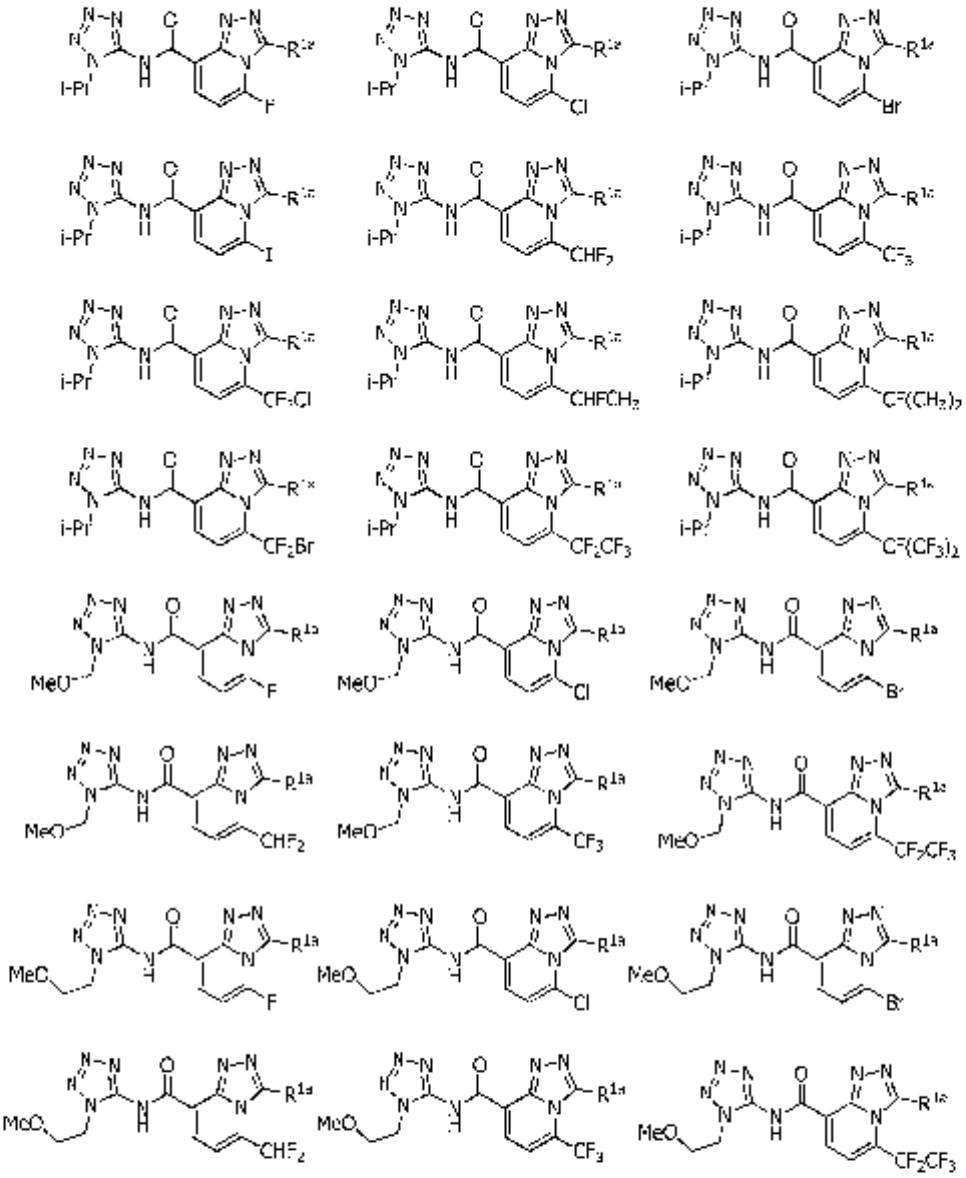
[化36]



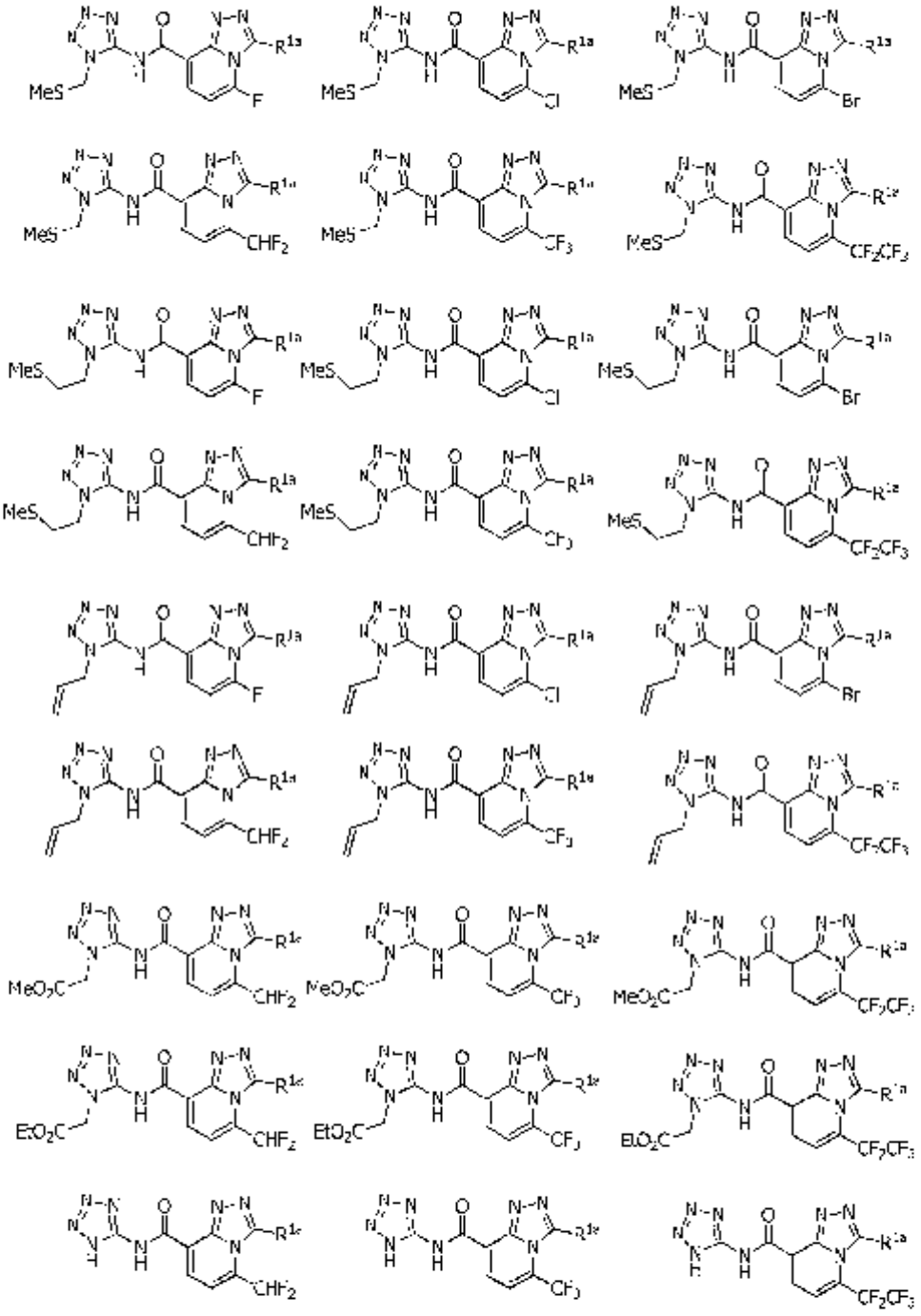
[化37]



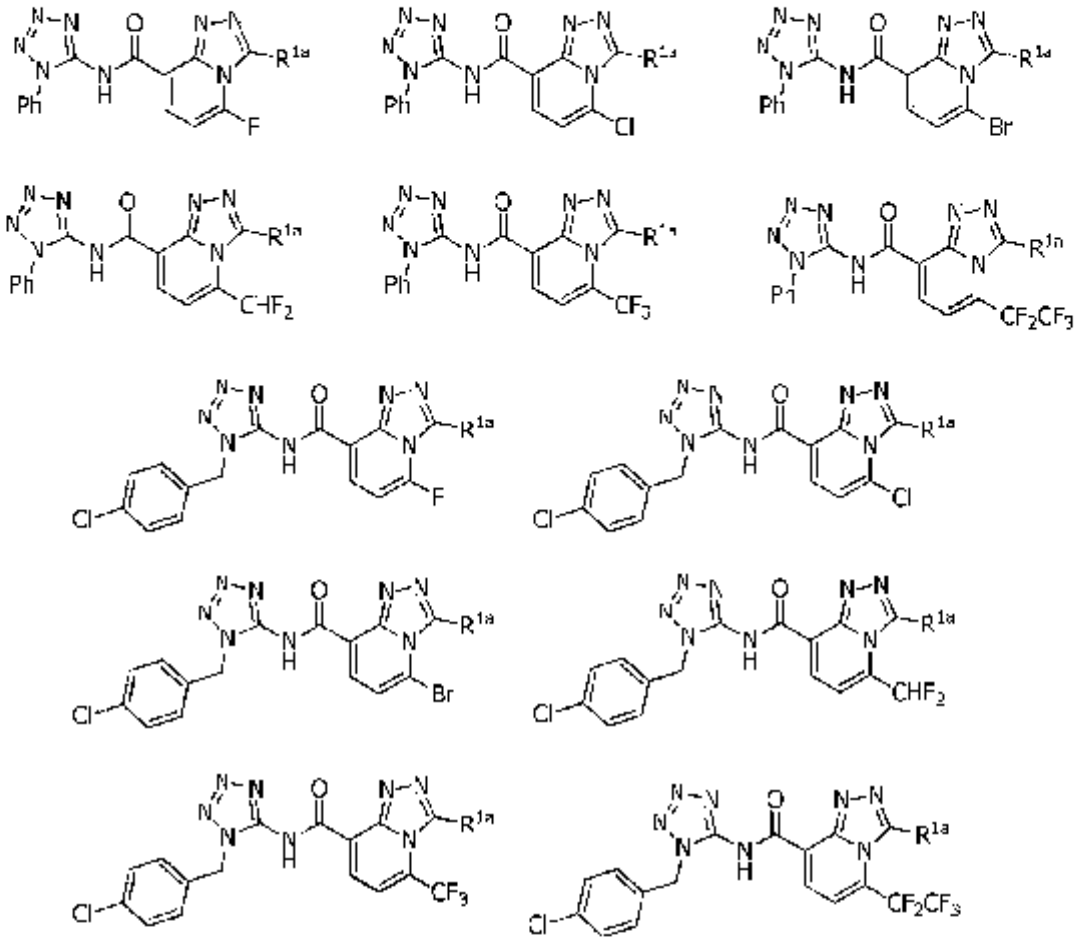
[化38]



[化39]



[化40]



[表13]

R^{1a}	R^{2a}	R^{3a}
H	CH_2OHex-n	$C(Me)_2OMe$
F	CH(Me)OMe	$C(Me)_2OEt$
Cl	CH(Me)OEt	$C(Me)_2OPr$-n
Br	CH(Me)OPr-n	$C(Me)_2OPr$-i
I	CH(Me)OPr-i	$C(Me)_2OBu$-n
Me	CH(Me)OBu-n	$C(Me)_2OBu$-i
Et	CH(Me)OBu-i	$C(Me)_2OBu$-s
Pr-n	CH(Me)OBu-s	$C(Me)_2OBu$-t
Pr-i	CH(Me)OBu-t	$(CH_2)_2OMe$
Pr-c	CH(Me)OPen-n	$(CH_2)_2OEt$
Bu-n	CH(Me)OPen-i	$(CH_2)_2OPr$-n
Bu-i	CH(Me)OPen-s	$(CH_2)_2OPr$-i
Bu-c	CH(Me)OPen-t	$(CH_2)_2OBu$-n
Bu-s	CH(Me)OHex-n	$(CH_2)_2OBu$-i
Bu-t	CH(Et)OMe	$(CH_2)_2OBu$-s
Pen-n	CH(Et)OEt	$(CH_2)_2OBu$-t
Pen-i	CH(Et)OPr-n	$CH(Me)CH_2OMe$
Pen-c	CH(Et)OPr-i	$CH(Me)CH_2OEt$
Pen-s	CH(Et)OBu-n	$CH(Me)CH_2OPr$-n
Pen-t	CH(Et)OBu-i	$CH(Me)CH_2OPr$-i
3-Pen	CH(Et)OBu-s	$CH(Me)CH_2OBu$-n
Hex-n	CH(Et)OBu-t	$CH(Me)CH_2OBu$-i
Hex-c	CH(Et)OPen-n	$CH(Me)CH_2OBu$-s
CH_2OMe	CH(Et)OPen-i	$CH(Me)CH_2OBu$-t
CH_2OEt	CH(Et)OPen-s	$CH(Et)CH_2OMe$
CH_2OPr-n	CH(Et)OPen-t	$CH(Et)CH_2OEt$
CH_2OPr-i	CH(Et)OHex-n	$(CH_2)_3OMe$
CH_2OBu-n	CH(Pr-n)OMe	$(CH_2)_3OEt$
CH_2OBu-i	CH(Pr-n)OEt	$(CH_2)_3OPr$-n
CH_2OBu-s	CH(Pr-n)OPr-n	$(CH_2)_3OPr$-i
CH_2OBu-t	CH(Pr-n)OPr-i	$(CH_2)_3OBu$-n
CH_2OPen-n	CH(Pr-i)OMe	$(CH_2)_3OBu$-i
CH_2OPen-i	CH(Pr-i)OEt	$(CH_2)_3OBu$-s
CH_2OPen-s	CH(Pr-i)OPr-n	$(CH_2)_3OBu$-t
CH_2OPen-t	CH(Pr-i)OPr-i	CH_2OCH_2H

[表14]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
CH_2OCF_3	CH(iPr)OH	$C(Me)_2OCH_2OPr$-n
$CH_2OCH_2CF_2H$	$C(Me)_2CH$	$C(Me)_2OCH_2OPr$-i
$CH_2OCH_2CF_3$	$(CH_2)_2OH$	$C(Me)_2O(CH_2)_2OMe$
$CH_2O(CH_2)_2CF_3$	CH(Me)CH_2OH	$C(Me)_2O(CH_2)_2OEt$
$CH_2O(CH_2)_2Cl$	$(CH_2)_3OH$	$C(Me)_2O(CH_2)_2OPr$-n
$CH_2O(CH_2)_2Br$	CH_2OCH_2OMe	$C(Me)_2O(CH_2)_2OPr$-i
$CH(Me)OCF_2H$	CH_2OCH_2OEt	$(CH_2)_2OCH_2OMe$
$CH(Me)OCF_3$	CH_2OCH_2OPr-n	$(CH_2)_2OCH_2OEt$
$CH(Me)OCH_2CF_2H$	CH_2OCH_2OPr-i	$(CH_2)_2OCH_2OPr$-n
$CH(Me)OCH_2CF_3$	$CH_2O(CH_2)_2OMe$	$(CH_2)_2OCH_2OPr$-i
$CH(Me)O(CH_2)_2CF_3$	$CH_2O(CH_2)_2OEt$	$(CH_2)_2O(CH_2)_2OMe$
$CH(Me)O(CH_2)_2Cl$	$CH_2O(CH_2)_2OPr$-n	$(CH_2)_2O(CH_2)_2OEt$
$CH(Me)O(CH_2)_2Br$	$CH_2O(CH_2)_2OPr$-i	$(CH_2)_2O(CH_2)_2OPr$-n
$CH(Et)OCF_2H$	$CH_2OCH(Me)CH_2OMe$	$(CH_2)_2O(CH_2)_2OPr$-i
$CH(Et)OCF_3$	$CH_2OCH(Me)CH_2OEt$	CH(Me)CH_2OCH_2OMe
$CH(Et)OCH_2CF_2H$	$CH_2OCH_2CH(Me)OMe$	CH(Me)CH_2OCH_2OEt
$CH(Et)OCH_2CF_3$	$CH_2OCH_2CH(Me)OEt$	CH(Me)$CH_2O(CH_2)_2OMe$
$CH(Et)O(CH_2)_2CF_3$	$CH_2OCH(Me)OMe$	CH(Me)$CH_2O(CH_2)_2OEt$
$CH(Et)O(CH_2)_2Cl$	$CH_2OCH(Me)OEt$	CH(Et)CH_2OCH_2OMe
$CH(Et)O(CH_2)_2Br$	$CH_2O(CH_2)_3OMe$	CH(Et)CH_2OCH_2OEt
$C(Me)_2OCF_2H$	$CH_2O(CH_2)_3OEt$	CH(Et)$CH_2O(CH_2)_2OMe$
$C(Me)_2OCF_3$	CH(Me)OCH_2OMe	CH(Et)$CH_2O(CH_2)_2OEt$
$C(Me)_2OCH_2CF_2H$	CH(Me)OCH_2OEt	CH(Et)$O(CH_2)_2OMe$
$C(Me)_2OCH_2CF_3$	CH(Me)OCH_2OPr-n	CH(Et)$O(CH_2)_2OEt$
$C(Me)_2O(CH_2)_2CF_3$	CH(Me)OCH_2OPr-i	CH(Et)$O(CH_2)_2OPr$-n
$C(Me)_2O(CH_2)_2Cl$	CH(Me)$O(CH_2)_2OMe$	CH(Et)$O(CH_2)_2OPr$-i
$C(Me)_2O(CH_2)_2Br$	CH(Me)$O(CH_2)_2OEt$	CH(Pr-n)$O(CH_2)_2OMe$
$(CH_2)_2OCF_3$	CH(Me)$O(CH_2)_2OPr$-n	CH(Pr-n)$O(CH_2)_2OEt$
$(CH_2)_2OCH_2CF_2H$	CH(Me)$O(CH_2)_2OPr$-i	CH(Pr-n)$O(CH_2)_2OPr$-n
$(CH_2)_2OCH_2CF_3$	CH(Me)$OCH(Me)CH_2OMe$	CH(Pr-n)$O(CH_2)_2OPr$-i
$(CH_2)_2O(CH_2)_2Cl$	CH(Me)$OCH(Me)CH_2OEt$	CH(Pr-i)$O(CH_2)_2OMe$
$(CH_2)_2O(CH_2)_2Br$	CH(Me)$OCH_2CH(Me)OMe$	CH(Pr-i)$O(CH_2)_2OEt$
CH_2OH	CH(Me)$OCH_2CH(Me)OEt$	CH(Pr-i)$O(CH_2)_2OPr$-n
CH(Me)OH	$C(Me)_2CCH_2OMe$	CH(Pr-i)$O(CH_2)_2OPr$-i
CH(Et)OH	$C(Me)_2CCH_2OEt$	$CH_2OC(O)Me$

[表15]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$CH_2OC(O)Et$	$CH(Et)C(O)OEt$	$CH_2S(O)Pen-n$
$CH_2OC(O)Pr-i$	$CH(Et)C(O)OPr-i$	$CH_2S(O)_2Pen-n$
$CH(Me)OC(O)Me$	$CH(Et)C(O)OCH_2OMe$	$CH_2SPen-i$
$CH(Me)OC(O)Et$	$CH(Et)C(O)O(CH_2)_2OMe$	$CH_2S(O)Pen-i$
$CH(Me)OC(O)Pr-i$	$CH(Et)C(O)O(CH_2)_2OEt$	$CH_2S(O)_2Pen-i$
$CH(Et)OC(O)Me$	$CH(Et)C(O)O(CH_2)_2OPr-i$	$CH_2SPen-s$
$CH(Et)OC(O)Et$	$(CH_2)_2C(O)OMe$	$CH_2S(O)Pen-s$
$CH(Et)OC(O)Pr-i$	$(CH_2)_2C(O)OEt$	$CH_2S(O)_2Pen-s$
CH_2OPh	$(CH_2)_2C(O)O(CH_2)_2OMe$	$CH_2SPen-t$
$CH(Me)OPh$	$(CH_2)_2C(O)O(CH_2)_2OEt$	$CH_2S(O)Pen-t$
$CH_2C(O)OMe$	CH_2SMe	$CH_2S(O)_2Pen-t$
$CH_2C(O)OEt$	$CH_2S(O)Me$	$CH_2SHex-r$
$CH_2C(O)OPr-n$	$CH_2S(O)_2Me$	$CH(Me)SMe$
$CH_2C(O)OPr-i$	CH_2SEt	$CH(Me)S(O)Me$
$CH_2C(O)OBu-n$	$CH_2S(O)Et$	$CH(Me)S(O)_2Me$
$CH_2C(O)OBu-i$	$CH_2S(O)_2Et$	$CH(Me)SEt$
$CH_2C(O)OBu-s$	CH_2SPr-n	$CH(Me)S(O)Et$
$CH_2C(O)OBu-t$	$CH_2S(O)Pr-n$	$CH(Me)S(O)_2Et$
$CH_2C(O)OPen-n$	$CH_2S(O)_2Pr-n$	$CH(Me)SPr-n$
$CH_2C(O)OPen-i$	CH_2SPr-i	$CH(Me)S(O)Pr-n$
$CH_2C(O)OPen-s$	$CH_2S(O)Pr-i$	$CH(Me)S(O)_2Pr-n$
$CH_2C(O)OPen-t$	$CH_2S(O)_2Pr-i$	$CH(Me)SPr-i$
$CH_2C(O)OHex-n$	CH_2SBu-n	$CH(Me)S(O)Pr-i$
$CH_2C(O)OCH_2OMe$	$CH_2S(O)Bu-n$	$CH(Me)S(O)_2Pr-i$
$CH_2C(O)O(CH_2)_2OMe$	$CH_2S(O)_2Bu-n$	$CH(Me)SBu-n$
$CH_2C(O)O(CH_2)_2OEt$	CH_2SBu-i	$CH(Me)S(O)Bu-n$
$CH_2C(O)O(CH_2)_2OPr-i$	$CH_2S(O)Bu-i$	$CH(Me)S(O)_2Bu-n$
$CH(Me)C(O)OMe$	$CH_2S(O)_2Bu-i$	$CH(Me)SBu-i$
$CH(Me)C(O)OEt$	CH_2SBu-s	$CH(Me)S(O)Bu-i$
$CH(Me)C(O)OPr-i$	$CH_2S(O)Bu-s$	$CH(Me)S(O)_2Bu-i$
$CH(Me)C(O)OCH_2OMe$	$CH_2S(O)_2Bu-s$	$CH(Me)SBu-s$
$CH(Me)C(O)O(CH_2)_2OMe$	CH_2SBu-t	$CH(Me)S(O)Bu-s$
$CH(Me)C(O)O(CH_2)_2OEt$	$CH_2S(O)Bu-t$	$CH(Me)S(O)_2Bu-s$
$CH(Me)C(O)O(CH_2)_2OPr-i$	$CH_2S(O)_2Bu-t$	$CH(Me)SBu-t$
$CH(Et)C(O)OMe$	$CH_2SPen-n$	$CH(Me)S(O)Bu-t$

[表16]

R^a	R^{1a}	R^{1a}
CH(Me)S(O)$_2$Bu-t	C(Me)$_2$SBu-t	CH(Me)CH$_2$S(O)$_2$Me
CH(Me)SPen-n	C(Me)$_2$S(O)Bu-t	CH(Me)CH$_2$SEt
CH(Me)S(O)Pen-n	C(Me)$_2$S(O)$_2$Bu-t	CH(Me)CH$_2$S(O)Et
CH(Me)S(O)$_2$Pen-n	C(Me)$_2$SPen-n	CH(Me)CH$_2$S(O)$_2$Et
CH(Me)SPen-i	C(Me)$_2$S(O)Pen-n	CH(Me)CH$_2$SPr-n
CH(Me)S(O)Pen-i	C(Me)$_2$S(O)$_2$Pen-n	CH(Me)CH$_2$S(O)Pr-n
CH(Me)S(O)$_2$Pen-i	C(Me)$_2$SPen-i	CH(Me)CH$_2$S(O)$_2$Pr-n
CH(Me)SPen-s	C(Me)$_2$S(O)Pen-i	CH(Me)CH$_2$SPr-i
CH(Me)S(O)Pen-s	C(Me)$_2$S(O)$_2$Pen-i	CH(Me)CH$_2$S(O)Pr-i
CH(Me)S(O)$_2$Pen-s	C(Me)$_2$SPen-s	CH(Me)CH$_2$S(O)$_2$Pr-i
CH(Me)SPen-t	C(Me)$_2$S(O)Pen-s	CH(Et)CH$_2$SMe
CH(Me)S(O)Pen-t	C(Me)$_2$S(O)$_2$Pen-s	CH(Et)CH$_2$S(O)Me
CH(Me)S(O)$_2$Pen-t	C(Me)$_2$SPen-t	CH(Et)CH$_2$S(O)$_2$Me
CH(Me)SHex-n	C(Me)$_2$S(O)Pen-t	CH(Et)CH$_2$SEt
C(Me)$_2$SMe	C(Me)$_2$S(O)$_2$Pen-t	CH(Et)CH$_2$S(O)Et
C(Me)$_2$S(O)Me	(CH$_2$)$_2$SMe	CH(Et)CH$_2$S(O)$_2$Et
C(Me)$_2$S(O)$_2$Me	(CH$_2$)$_2$S(O)Me	C(Me)$_2$CH$_2$SMe
C(Me)$_2$SEt	(CH$_2$)$_2$S(O)$_2$Me	C(Me)$_2$CH$_2$S(O)Me
C(Me)$_2$S(O)Et	(CH$_2$)$_2$SEt	C(Me)$_2$CH$_2$S(O)$_2$Me
C(Me)$_2$S(O)$_2$Et	(CH$_2$)$_2$S(O)Et	C(Me)$_2$CH$_2$SEt
C(Me)$_2$SPr-n	(CH$_2$)$_2$S(O)$_2$Et	C(Me)$_2$CH$_2$S(O)Et
C(Me)$_2$S(O)Pr-n	(CH$_2$)$_2$SPr-n	C(Me)$_2$CH$_2$S(O)$_2$Et
C(Me)$_2$S(O)$_2$Pr-n	(CH$_2$)$_2$S(O)Pr-n	C(Me)$_2$CH$_2$SPr-n
C(Me)$_2$SPr-i	(CH$_2$)$_2$S(O)$_2$Pr-n	C(Me)$_2$CH$_2$S(O)Pr-n
C(Me)$_2$S(O)Pr-i	(CH$_2$)$_2$SPr-i	C(Me)$_2$CH$_2$S(O)$_2$Pr-n
C(Me)$_2$S(O)$_2$Pr-i	(CH$_2$)$_2$S(O)Pr-i	C(Me)$_2$CH$_2$SPr-i
C(Me)$_2$SBu-n	(CH$_2$)$_2$S(O)$_2$Pr-i	C(Me)$_2$CH$_2$S(O)Pr-i
C(Me)$_2$S(O)Bu-n	(CH$_2$)$_3$SMe	C(Me)$_2$CH$_2$S(O)$_2$Pr-i
C(Me)$_2$S(O)$_2$Bu-n	(CH$_2$)$_3$S(O)Me	CH(Et)SMe
C(Me)$_2$SBu-i	(CH$_2$)$_3$S(O)$_2$Me	CH(Et)S(O)Me
C(Me)$_2$S(O)Bu-i	(CH$_2$)$_3$SEt	CH(Et)S(O)$_2$Me
C(Me)$_2$S(O)$_2$Bu-i	(CH$_2$)$_3$S(O)Et	CH(Et)SEt
C(Me)$_2$SBu-s	(CH$_2$)$_3$S(O)$_2$Et	CH(Et)S(O)Et
C(Me)$_2$S(O)Bu-s	CH(Me)CH$_2$SMe	CH(Et)S(O)$_2$Et
C(Me)$_2$S(O)$_2$Bu-s	CH(Me)CH$_2$S(O)Me	CH(Et)SPr-n

[表17]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
CH(Et)S(O)Pr-n	$CH_2SCH_2CF_2H$	$CH(Me)S(O)(CH_2)_2CF_3$
CH(Et)S(O)$_2$Pr-n	$CH_2S(O)CH_2CF_2H$	$CH(Me)S(O)_2(CH_2)_2CF_3$
CH(Et)SPr-i	$CH_2S(O)_2CH_2CF_2H$	$CH(Me)S(CH_2)_2Cl$
CH(Et)S(O)Pr-i	$CH_2SCH_2CF_3$	$CH(Me)S(O)(CH_2)_2Cl$
CH(Et)S(O)$_2$Pr-i	$CH_2S(O)CH_2CF_3$	$CH(Me)S(O)_2(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-n)SMe	$CH_2S(O)_2CH_2CF_3$	$CH(Me)S(CH_2)_2Br$
CH(Pr-n)S(O)Me	$CH_2S(CH_2)_2CF_3$	$CH(Me)S(O)(CH_2)_2Br$
CH(Pr-n)S(O)$_2$Me	$CH_2S(O)(CH_2)_2CF_3$	$CH(Me)S(O)_2(CH_2)_2Br$
CH(Pr-n)SEt	$CH_2S(O)_2(CH_2)_2CF_3$	$C(Me)_2SCF_2H$
CH(Pr-n)S(O)Et	$CH_2S(CH_2)_2Cl$	$C(Me)_2S(O)CF_2H$
CH(Pr-n)S(O)$_2$Et	$CH_2S(O)(CH_2)_2Cl$	$C(Me)_2S(O)_2CF_2H$
CH(Pr-n)SPr-n	$CH_2S(O)_2(CH_2)_2Cl$	$C(Me)_2SCF_3$
CH(Pr-n)S(O)Pr-n	$CH_2S(CH_2)_2Br$	$C(Me)_2S(O)CF_3$
CH(Pr-n)S(O)$_2$Pr-n	$CH_2S(O)(CH_2)_2Br$	$C(Me)_2S(O)_2CF_3$
CH(Pr-n)SPr-i	$CH_2S(O)_2(CH_2)_2Br$	$C(Me)_2SCH_2CF_2H$
CH(Pr-n)S(O)Pr-i	$CH_2SCHFCH_3$	$C(Me)_2S(O)CH_2CF_2H$
CH(Pr-n)S(O)$_2$Pr-i	$CH_2SCF_2CH_3$	$C(Me)_2S(O)_2CH_2CF_2H$
CH(Pr-i)SMe	$CH_2SCF(CH_3)_2$	$C(Me)_2SCH_2CF_3$
CH(Pr-i)S(O)Me	$CH_2SCF_2CF_2H$	$C(Me)_2S(O)CH_2CF_3$
CH(Pr-i)S(O)$_2$Me	$CH_2SCF_2CF_3$	$C(Me)_2S(O)_2CH_2CF_3$
CH(Pr-i)SEt	$CH_2SCF_2CF_2CF_3$	$C(Me)_2S(CH_2)_2CF_3$
CH(Pr-i)S(O)Et	$CH_2SCF(CF_3)_2$	$C(Me)_2S(O)(CH_2)_2CF_3$
CH(Pr-i)S(O)$_2$Et	$CH(Me)SCF_2H$	$C(Me)_2S(O)_2(CH_2)_2CF_3$
CH(Pr-i)SPr-n	$CH(Me)S(O)CF_2H$	$C(Me)_2S(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-i)S(O)Pr-n	$CH(Me)S(O)_2CF_2H$	$C(Me)_2S(O)(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-i)S(O)$_2$Pr-n	$CH(Me)SCF_3$	$C(Me)_2S(O)_2(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-i)SPr-i	$CH(Me)S(O)CF_3$	$C(Me)_2S(CH_2)_2Br$
CH(Pr-i)S(O)Pr-i	$CH(Me)S(O)_2CF_3$	$C(Me)_2S(O)(CH_2)_2Br$
CH(Pr-i)S(O)$_2$Pr-i	$CH(Me)SCH_2CF_2H$	$C(Me)_2S(O)_2(CH_2)_2Br$
CH_2SCF_2H	$CH(Me)S(O)CH_2CF_2H$	$(CH_2)_2SCF_3$
$CH_2S(O)CF_2H$	$CH(Me)S(O)_2CH_2CF_2H$	$(CH_2)_2S(O)CF_3$
$CH_2S(O)_2CF_2H$	$CH(Me)SCH_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)_2CF_3$
CH_2SCF_3	$CH(Me)S(O)CH_2CF_3$	$(CH_2)_2SCH_2CF_2H$
$CH_2S(O)CF_3$	$CH(Me)S(O)_2CH_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)CH_2CF_2H$
$CH_2S(O)_2CF_3$	$CH(Me)S(CH_2)_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)_2CH_2CF_2H$

[表18]

R^{13}	R^{13}	R^{13}
$(CH_2)_2SCH_2CF_3$	3-Cl-Ph	2-Cl-3-Me-Ph
$(CH_2)_2S(O)CH_2CF_3$	4-Cl-Ph	2-Cl-4-Me-Ph
$(CH_2)_2S(O)_2CH_2CF_3$	2-Br-Ph	2-Cl-5-Me-Ph
$(CH_2)_2S(CH_2)_2C$	3-Br-Ph	3-Cl-4-Me-Ph
$(CH_2)_2S(O)(CH_2)_2Cl$	4-Br-Ph	3-Cl-5-Me-Ph
$(CH_2)_2S(O)_2(CH_2)_2Cl$	2-Me-Ph	2-Cl-3-F-Ph
$(CH_2)_2S(CH_2)_2Br$	3-Me-Ph	2-Cl-4-F-Ph
$(CH_2)_2S(O)(CH_2)_2Br$	4-Me-Ph	2-Cl-5-F-Ph
$(CH_2)_2S(O)_2(CH_2)_2Br$	2-MeO-Ph	3-Cl-4-F-Ph
$CH=CH_2$	3-MeO-Ph	3-Cl-5-F-Ph
$CH=CHMe$	4-MeO-Ph	2-F-3-Me-Ph
$CH=CMe_2$	2,3-$(F)_2$-Ph	2-F-4-Me-Ph
$CH_2CH=CH_2$	2,4-$(F)_2$-Ph	2-F-5-Me-Ph
$CH_2CH=CHMe$	2,5-$(F)_2$-Ph	3-F-4-Me-Ph
$CH_2C(Me)=CH_2$	2,6-$(F)_2$-Ph	3-F-5-Me-Ph
$(CH_2)_2CH=CMe_2$	3,4-$(F)_2$-Ph	2-F-3-Cl-Ph
$C(Me)=CH_2$	3,5-$(F)_2$-Ph	2-F-4-Cl-Ph
$C(Me)=CHMe$	2,3-$(Cl)_2$-Ph	2-F-5-Cl-Ph
$C(Me)=CMe_2$	2,4-$(Cl)_2$-Ph	3-F-4-Cl-Ph
$CH(Me)CH=CH_2$	2,5-$(Cl)_2$-Ph	3-F-5-Cl-Ph
$C(Et)=CH_2$	2,6-$(Cl)_2$-Ph	2-Me-3-F-Ph
$C(Et)=CHMe$	3,4-$(Cl)_2$-Ph	2-Me-4-F-Ph
$C(Et)=CMe_2$	3,5-$(Cl)_2$-Ph	2-Me-5-F-Ph
$CH(Et)CH=CH_2$	2,3-$(Me)_2$-Ph	3-Me-4-F-Ph
$C\equiv CH$	2,4-$(Me)_2$-Ph	3-Me-5-F-Ph
$C\equiv CMe$	2,5-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-3-MeO-Ph
$CH_2C\equiv CH$	2,6-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-4-MeO-Ph
$CH_2C\equiv CMe$	3,4-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-5-MeO-Ph
$CH(Me)C\equiv CH$	3,5-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-6-MeO-Ph
$CH(Me)C\equiv CMe$	2,3-$(MeO)_2$-Ph	3-Cl-4-MeO-Ph
Ph	2,4-$(MeO)_2$-Ph	3-Cl-5-MeO-Ph
2-F-Ph	2,5-$(MeO)_2$-Ph	2-F-3-MeO-Ph
3-F-Ph	2,6-$(MeO)_2$-Ph	2-F-4-MeO-Ph
4-F-Ph	3,4-$(MeO)_2$-Ph	2-F-5-MeO-Ph
2-Cl-Ph	3,5-$(MeO)_2$-Ph	2-F-6-MeO-Ph

[表19]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
3-F-4-MeO-Ph	D-8	CH_2(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
3-F-5-MeO-Ph	D-8a	CH_2(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-3-F-Ph	D-8b	CH_2(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-4-F-Ph	D-8c	CH_2(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-5-F-Ph	D-8d	CH_2(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-6-F-Ph	D-8e	CH(Me)(2-MeO-Ph)
3-MeO-4-F-Ph	D-8f	CH(Me)(3-MeO-Ph)
3-MeO-5-F-Ph	D-8g	CH(Me)(4-MeO-Ph)
2-MeO-3-Cl-Ph	D-8h	CH(Me)(2,3-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-4-Cl-Ph	D-10a	CH(Me)(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-5-Cl-Ph	D-11	CH(Me)(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-6-Cl-Ph	D-14	CH(Me)(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
3-MeO-4-Cl-Ph	D-16	CH(Me)(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
3-MeO-5-Cl-Ph	D-16a	CH(Me)(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
2-Me-3-MeO-Ph	D-16b	CH(Et)(2-MeO-Ph)
2-Me-4-MeO-Ph	D-16c	CH(Et)(3-MeO-Ph)
2-Me-5-MeO-Ph	D-16d	CH(Et)(4-MeO-Ph)
2-Me-6-MeO-Ph	D-16e	$(CH_2)_2$(2-MeO-Ph)
3-Me-4-MeO-Ph	D-16f	$(CH_2)_2$(3-MeO-Ph)
3-Me-5-MeO-Ph	D-16g	$(CH_2)_2$(4-MeO-Ph)
2-MeO-3-Me-Ph	D-16h	CHO
2-MeO-4-Me-Ph	D-16i	SMe
2-MeO-5-Me-Ph	D-16j	S(O)Me
2-MeO-6-Me-Ph	D-16k	$S(O)_2$Me
3-MeO-4-Me-Ph	D-16m	SEt
3-MeO-5-Me-Ph	D-16n	S(O)Et
3,5-$(F)_2$-4-Me-Ph	D-16o	$S(O)_2$Et
3,5-$(F)_2$-4-MeO-Ph	D-17	SPr-n
3,4,5-$(MeO)_3$-Ph	D-17a	S(O)Pr-n
D-3	D-17b	$S(O)_2$Pr-n
D-3a	CH_2Ph	SPr-i
D-4	CH_2(2-MeO-Ph)	S(O)Pr-i
D-4a	CH_2(3-MeO-Ph)	$S(O)_2$Pr-i
D-4b	CH_2(4-MeO-Ph)	SPr-c
D-5	CH_2(2,3-$(MeO)_2$-Ph)	S(O)Pr-c

[表20]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$S(O)_2Pr-c$	$S(O)Pen-t$	$SCHFCH_3$
S(D-16)	$S(O)_2Pen-t$	SCH_2CH_3
S(O)(D-16)	SHex-n	$SCF(CH_3)_2$
$S(O)_2$(D-16)	SHex-c	SCF_2CF_2H
S(D-16e)	$SCH_2CH=CH_2$	SCF_2CF_3
S(O)(D-16e)	$S(O)CH_2CH=CH_2$	$SCF_2CF_2CF_3$
$S(O)_2$(D-16e)	$S(O)_2CH_2CH=CH_2$	$SCF(CF_3)_2$
SBu-n	$SCH(Me)CH=CH_2$	SCH_2OMe
S(O)Bu-n	$SC(Me)_2CH=CH_2$	$S(CH_2)_2OMe$
$S(O)_2$Bu-n	$SCH_2CH=CHMe$	$S(O)(CH_2)_2OMe$
SBu-i	$SCH_2C(Me)=CH_2$	$S(O)_2(CH_2)_2OMe$
S(O)Bu-i	$SCH_2CH=CMe_2$	$SCH(Me)CH_2OMe$
$S(O)_2$Bu-i	$SC(Me)=CH_2$	$S(O)CH(Me)CH_2OMe$
SBu-c	SC(Me)=CH(Me)	$S(O)_2CH(Me)CH_2OMe$
S(O)Bu-c	$SCH_2C\equiv CH$	$SCH_2CH(Me)OMe$
$S(O)_2$Bu-c	$S(O)CH_2C\equiv CH$	$S(O)CH_2CH(Me)OMe$
SBu-s	$S(O)_2CH_2C\equiv CH$	$S(O)_2CH_2CH(Me)OMe$
S(O)Bu-s	$SCH(Me)C\equiv CH$	$SC(Me)_2CH_2OMe$
$S(O)_2$Bu-s	$SC(Me)_2C\equiv CH$	$S(CH_2)_3OMe$
SBu-t	$SCH_2C\equiv CMe$	SCH_2OEt
S(O)Bu-t	SCH_2Cl	$S(CH_2)_2OEt$
$S(O)_2$Bu-t	SCH(Me)Cl	$S(O)(CH_2)_2OEt$
SPen-r	$S(CH_2)_2Cl$	$S(O)_2(CH_2)_2OEt$
S(O)Pen-n	$S(O)(CH_2)_2Cl$	$SCH(Me)CH_2OEt$
$S(O)_2$Pen-n	$S(O)_2(CH_2)_2Cl$	SCH_2OPr-
SPen-i	$SCH(Me)CH_2Cl$	$S(CH_2)_2OPr-i$
S(O)Pen-i	$SCH_2CH(Me)Cl$	$S(O)(CH_2)_2OPr-i$
$S(O)_2$Pen-	$S(CH_2)_3Cl$	$S(O)_2(CH_2)_2OPr-i$
SPen-c	SCF_3	$SCH(Me)CH_2OPr-i$
S(O)Pen-c	SCH_2CF_3	SCH_2Pr-c
$S(O)_2$Pen-c	$S(O)CH_2CF_3$	$S(O)CH_2Pr-c$
SPen-s	$S(O)_2CH_2CF_3$	$S(O)_2CH_2Pr-c$
S(O)Pen-s	$SCH(Me)CF_3$	$SCH(Me)Pr-c$
$S(O)_2$Pen-s	$SCH_2)_2CF_3$	$S(O)CH(Me)Pr-c$
SPen-t	$S(CH_2)_3CF_3$	$S(O)_2CH(Me)Pr-c$

[表21]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$S(CH_2)_2Pr-c$	SCH(Me)Ph	SCH_2(D-8f)
SCH_2(D-16)	S(O)CH(Me)Ph	$S(O)_2CH_2$(D-8f)
$S(O)CH_2$(D-16)	$S(O)_2CH(Me)Ph$	SCH(D-8g)
$S(O)_2CH_2$(D-16)	SCH_2(2-MeO-Ph)	$S(O)_2CH_2$(D-8g)
SCH_2(D-16e)	$S(O)CH_2$(2-MeO-Ph)	SCH_2(D-8h)
$S(O)CH_2$(D-16e)	$S(O)_2CH_2$(2-MeO-Ph)	$S(O)_2CH_2$(D-8h)
$S(O)_2CH_2$(D-16e)	SCH(Me)(2-MeO-Ph)	SCH_2(D-15)
SCH_2Bu-c	S(O)CH(Me)(2-MeO-Ph)	$S(O)CH_2$(D-15)
$S(O)CH_2Bu-c$	$S(O)_2CH(Me)$(2-MeO-Ph)	$S(O)_2CH_2$(D-15)
$S(O)_2CH_2Bu-c$	SCH_2(3-MeO-Ph)	SCH(Me)(D-15)
SCH(Me)Bu-c	$S(O)CH_2$(3-MeO-Ph)	S(O)CH(Me)(D-15)
$S(CH_2)_2Bu-c$	$S(O)_2CH_2$(3-MeO-Ph)	$S(O)_2CH(Me)$(D-15)
SCH_2Pen-c	SCH(Me)(3-MeO-Ph)	$S(CH_2)_2$(D-15)
$S(O)CH_2Pen-c$	S(O)CH(Me)(3-MeO-Ph)	$S(O)(CH_2)_2$(D-15)
$S(O)_2CH_2Pen-c$	$S(O)_2CH(Me)$(3-MeO-Ph)	$S(O)_2(CH_2)_2$(D-15)
SCH(Me)Pen-c	SCH_2(4-MeO-Ph)	NHMe
$S(CH_2)_2Pen-c$	$S(O)CH_2$(4-MeO-Ph)	NHEt
SCH_2Hex-c	$S(O)_2CH_2$(4-MeO-Ph)	NHPr-n
SCH(Me)Hex-c	SCH(Me)(4-MeO-Ph)	NHPr-i
$S(CH_2)_2Hex-c$	S(O)CH(Me)(4-MeO-Ph)	NHPr-c
SCH_2CN	$S(O)_2CH(Me)$(4-MeO-Ph)	NH(D-16)
$S(O)CH_2CN$	SCH_2(D-8a)	NH(D-16e)
$S(O)_2CH_2CN$	$S(O)CH_2$(D-8a)	NHBu-n
SCH(Me)CN	$S(O)_2CH_2$(D-8a)	NHBu-i
S(O)CH(Me)CN	SCH_2(D-8b)	NHBu-c
$S(O)_2CH(Me)CN$	$S(O)CH_2$(D-8b)	NHBu-s
$SC(Me)_2CN$	$S(O)_2CH_2$(D-8b)	NHBu-t
$S(O)C(Me)_2CN$	SCH_2(D-8c)	NHPen-n
$S(O)_2C(Me)_2CN$	$S(O)CH_2$(D-8c)	NHPen-i
$S(CH_2)_2CN$	$S(O)_2CH_2$(D-8c)	NHPen-c
$S(O)(CH_2)_2CN$	SCH_2(D-8d)	NHPen-s
$S(O)_2(CH_2)_2CN$	$S(O)CH_2$(D-8d)	NHPen-t
SCH_2Ph	$S(O)_2CH_2$(D-8d)	NH(3-Pen)
$S(O)CH_2Ph$	SCH_2(D-8e)	NHHex-n
$S(O)_2CH_2Ph$	$S(O)CH_2$(D-8e)	NHHex-c

[表22]

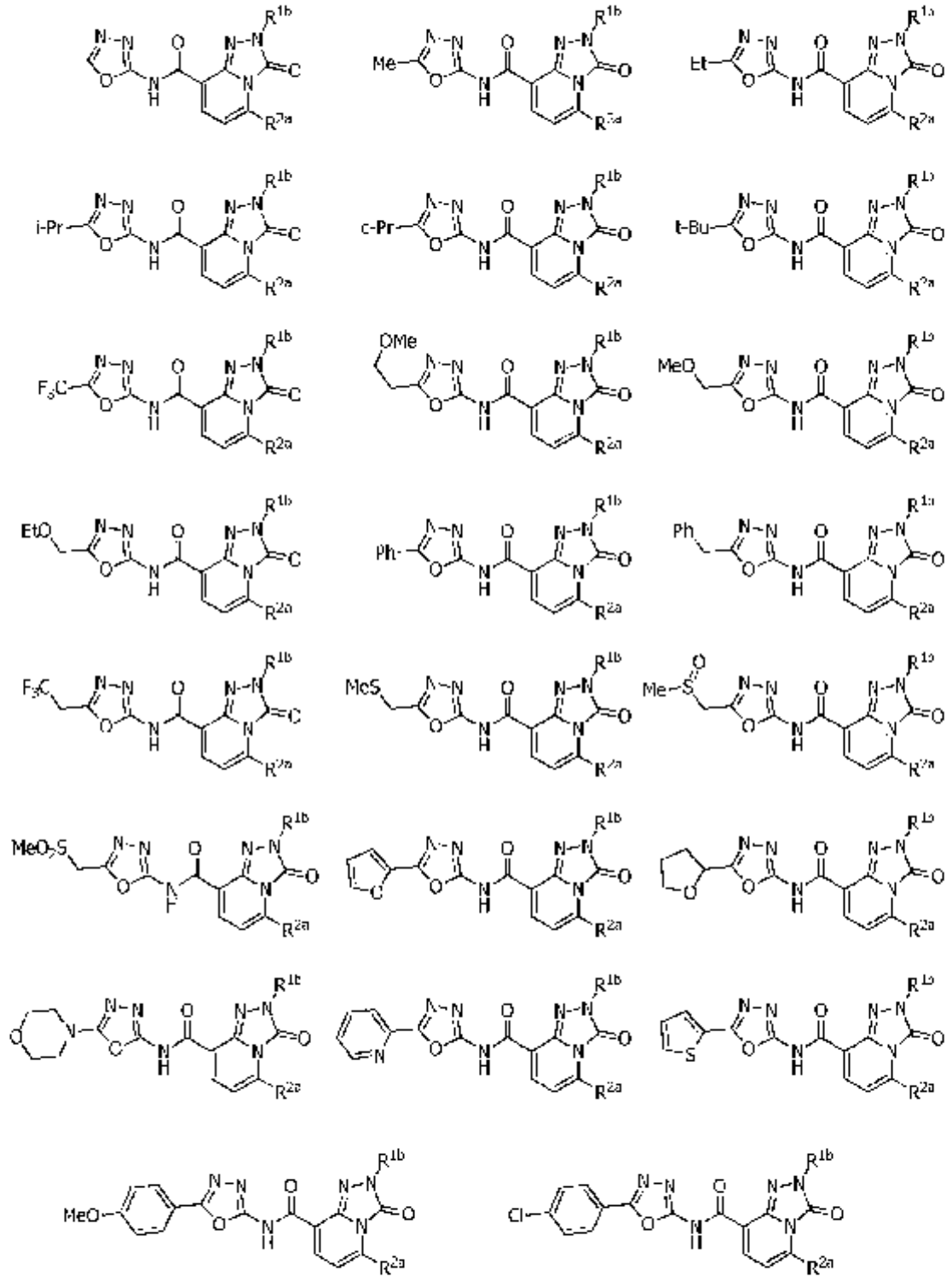
R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
N(Me)Me	N(Pr-n)Bu-n	N(Et)$(CH_2)_2$OEt
N(Me)Et	N(Pr-n)Bu-i	N(Et)$(CH_2)_2$OPr-n
N(Me)Pr-n	N(Pr-n)Bu-c	N(Et)$(CH_2)_2$OPr-i
N(Me)Pr-i	N(Pr-n)Bu-s	N(Pr-n)$(CH_2)_2$OMe
N(Me)Pr-c	N(Pr-i)Pr-i	N(Pr-n)$(CH_2)_2$OEt
N(Me)(D-16)	N(Pr-i)Pr-c	N(Pr-n)$(CH_2)_2$OPr-n
N(Me)(D-16e)	N(Pr-i)(D-16)	N(Pr-n)$(CH_2)_2$OPr-i
N(Me)Bu-n	N(Pr-i)(D-16e)	N(Pr-i)$(CH_2)_2$OMe
N(Me)Bu-i	N(Pr-i)Bu-n	N(Pr-i)$(CH_2)_2$OEt
N(Me)Bu-c	N(Pr-i)Bu-i	N(Pr-i)$(CH_2)_2$OPr-n
N(Me)Bu-s	N(Pr-i)Bu-c	N(Pr-i)$(CH_2)_2$OPr-i
N(Me)Bu-t	N(Pr-i)Bu-s	NHCH_2CH_2SMe
N(Me)Pen-n	NHCH_2OMe	NHCH_2SEt
N(Me)Pen-i	NHCH_2OEt	NHCH(Me)SMe
N(Me)Pen-c	NHCH(Me)OMe	NHCH(Me)SEt
N(Me)Pen-s	NHCH(Me)OEt	NHC$(Me)_2$SMe
N(Me)Pen-t	NHC$(Me)_2$OMe	NHC$(Me)_2$SEt
N(Me)(3-Pen)	NHC$(Me)_2$OEt	NH$(CH_2)_2$SMe
N(Me)Hex-n	NH$(CH_2)_2$OMe	NH$(CH_2)_2$S(O)Me
N(Me)Hex-c	NH$(CH_2)_2$OEt	NH$(CH_2)_2$S$(O)_2$Me
N(Et)Et	NH$(CH_2)_2$OPr-n	NH$(CH_2)_2$SEt
N(Et)Pr-n	NH$(CH_2)_2$OPr-i	NH$(CH_2)_2$S(O)Et
N(Et)Pr-i	N(Me)CH_2OMe	NH$(CH_2)_2$S$(O)_2$Et
N(Et)Pr-c	N(Me)CH_2OEt	NH$(CH_2)_2$SPr-i
N(Et)(D-16)	N(Me)CH(Me)OMe	NH$(CH_2)_2$S(O)Pr-i
N(Et)(D-16e)	N(Me)CH(Me)OEt	NH$(CH_2)_2$S$(O)_2$Pr-i
N(Et)Bu-n	N(Me)C$(Me)_2$OMe	N(Me)CH_2SMe
N(Et)Bu-i	N(Me)C$(Me)_2$OEt	N(Me)CH_2SEt
N(Et)Bu-c	N(Me)$(CH_2)_2$OMe	N(Me)CH(Me)SMe
N(Et)Bu-s	N(Me)$(CH_2)_2$OEt	N(Me)CH(Me)SEt
N(Pr-n)Pr-n	N(Me)$(CH_2)_2$OPr-n	N(Me)C$(Me)_2$SMe
N(Pr-n)Pr-i	N(Me)$(CH_2)_2$OPr-i	N(Me)C$(Me)_2$SEt
N(Pr-n)Pr-c	N(Et)C$(Me)_2$OMe	N(Me)$(CH_2)_2$SMe
N(Pr-n)(D-16)	N(Et)C$(Me)_2$OEt	N(Me)$(CH_2)_2$S(O)Me
N(Pr-n)(D-16e)	N(Et)$(CH_2)_2$OMe	N(Me)$(CH_2)_2$S$(O)_2$Me

[表23]

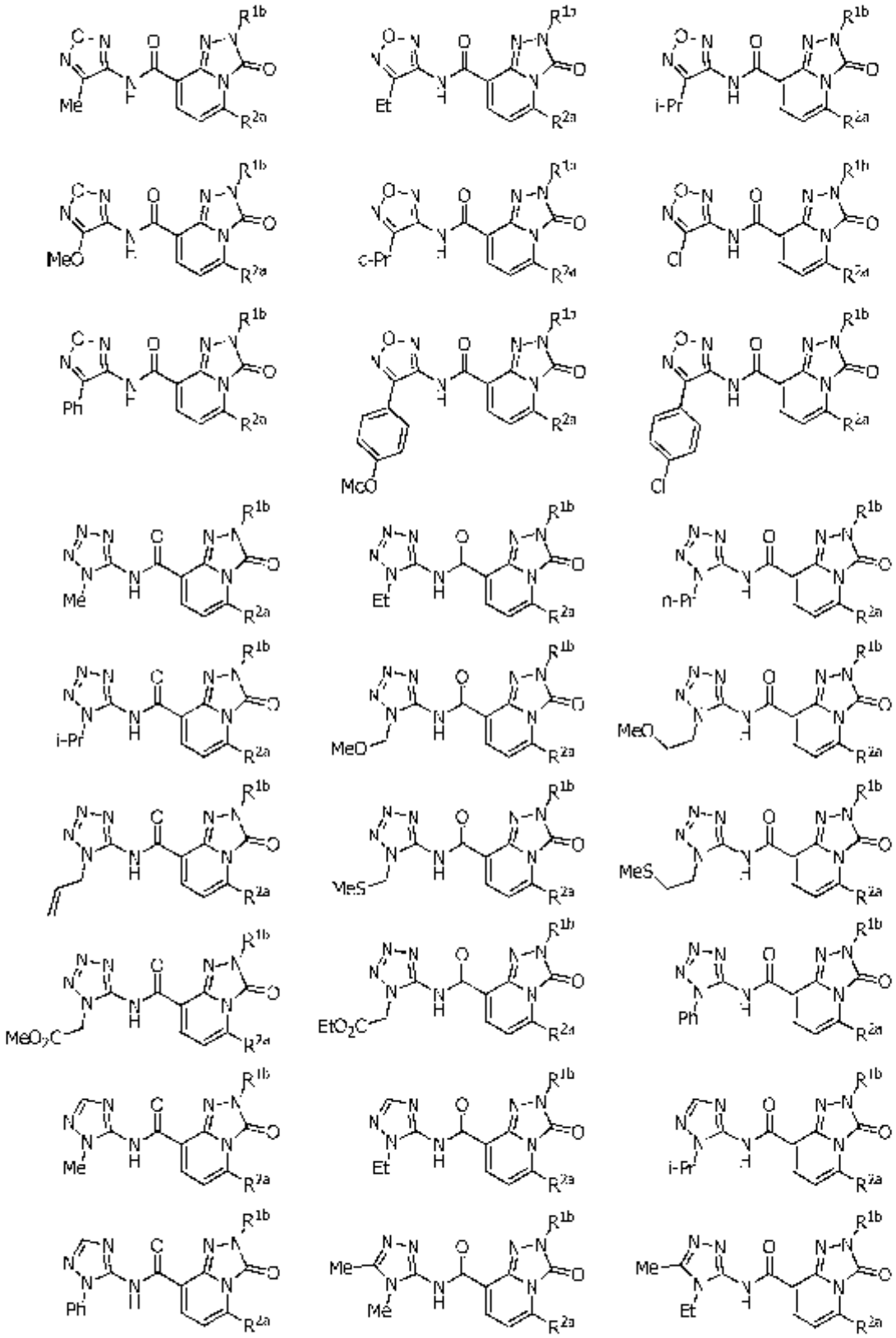
R'a	R'a
N(Me)$(CH_2)_2$SEt	NH(4-MeO-Ph)
N(Me)$(CH_2)_2$S(O)Et	NH(2,3-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)$(CH_2)_2$S(O)$_2$Et	NH(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)$(CH_2)_2$SPr-i	NH(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)$(CH_2)_2$S(O)Pr-i	NH(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)$(CH_2)_2$S(O)$_2$Pr-i	NH(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
NHCH_2H	NH(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
NHCF_3	N(Me)Ph
NHCH_2CF_2H	N(Me)(2-MeO-Ph)
NHCH_2CF_3	N(Me)(3-MeO-Ph)
NH$(CH_2)_2$CF_3	N(Me)(4-MeO-Ph)
NH$(CH_2)_2$Cl	N(Me)(2,3-$(MeO)_2$-Ph)
NH$(CH_2)_3$Cl	N(Me)(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)CF_2H	N(Me)(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)CF_3	N(Me)(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)CH_2CF_2H	N(Me)(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)CH_2CF_3	N(Me)(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)$(CH_2)_2$CF_3	
N(Me)$(CH_2)_2$Cl	
N(Me)$(CH_2)_3$Cl	
NHCH_2CH=CH_2	
N(Me)CH_2CH=CH_2	
NHCH_2C≡CH	
NHCH_2C≡CMe	
N(Me)CH_2C≡CH	
N(Me)CH_2C≡CMe	
NHCH_2CN	
NH$(CH_2)_2$CN	
NH$(CH_2)_3$CN	
N(Me)CH_2CN	
N(Me)$(CH_2)_2$CN	
N(Me)$(CH_2)_3$CN	
NHPh	
NH(2-MeO-Ph)	
NH(3-MeO-Ph)	

[0191] [第３表]

[化41]



[化42]



[表24]

R^{2a}	R^{1b}	R^{2a}	R^{1b}
CF_2H	Me	CF_2Cl	Pen-c
CF_2H	Et	CF_2Cl	Pen-s
CF_2H	Pr-n	CF_2Cl	Pen-t
CF_2H	Pr-i	CF_2Cl	3-Pen
CF_2H	Pr-c	CF_2Cl	Hex-n
CF_2H	Bu-n	CF_2Cl	Hex-c
CF_2H	Bu-i	CF_2Cl	CH_2Ph
CF_2H	Bu-c	CF_2Cl	CH(Me)Ph
CF_2H	Bu-s	CF_2Cl	$(CH_2)_2Ph$
CF_2H	Bu-t	CF_2Cl	$(CH_2)_3Ph$
CF_2H	Pen-n	CF_2Br	Me
CF_2H	Pen-i	CF_2Br	Et
CF_2H	Pen-c	CF_2Br	Pr-n
CF_2H	Pen-s	CF_2Br	Pr-i
CF_2H	Pen-t	CF_2Br	Pr-c
CF_2H	3-Pen	CF_2Br	Bu-n
CF_2H	Hex-n	CF_2Br	Bu-i
CF_2H	Hex-c	CF_2Br	Bu-c
CF_2H	CH_2Ph	CF_2Br	Bu-s
CF_2H	CH(Me)Ph	CF_2Br	Bu-t
CF_2H	$(CH_2)_2Ph$	CF_2Br	CH_2Ph
CF_2H	$(CH_2)_3Ph$	CF_2Br	CH(Me)Ph
CF_2Cl	Me	CF_3	Me
CF_2Cl	Et	CF_3	Et
CF_2Cl	Pr-n	CF_3	Pr-n
CF_2Cl	Pr-i	CF_3	Pr-i
CF_2Cl	Pr-c	CF_3	Pr-c
CF_2Cl	Bu-n	CF_3	Bu-n
CF_2Cl	Bu-i	CF_3	Bu-i
CF_2Cl	Bu-c	CF_3	Bu-c
CF_2Cl	Bu-s	CF_3	Bu-s
CF_2Cl	Bu-t	CF_3	Bu-t
CF_2Cl	Pen-n	CF_3	Pen-n
CF_2Cl	Pen-i	CF_3	Pen-i

[表25]

R^{2a}	R^{1b}
CF_3	Pen-c
CF_3	Pen-s
CF_3	Pen-t
CF_3	3-Pen
CF_3	Hex-n
CF_3	Hex-i
CF_3	CH_2Ph
CF_3	CH(Me)Ph
CF_3	$(CH_2)_2Ph$
CF_3	$(CH_2)_3Ph$
CH_2CF_2H	Me
CH_2CF_2H	Et
CH_2CF_2H	Pr-n
CH_2CF_2H	Pr-i
CH_2CF_2H	Pr-c
CH_2CF_2H	Bu-n
CH_2CF_2H	Bu-i
CH_2CF_2H	Bu-c
CH_2CF_2H	Bu-s
CH_2CF_2H	Bu-t
CH_2CF_2H	CH_2Ph
CH_2CF_2H	CH(Me)Ph
CH_2CF_3	Me
CH_2CF_3	Et
CH_2CF_3	Pr-n
CH_2CF_3	Pr-i
CH_2CF_3	Pr-c
CH_2CF_3	Bu-n
CH_2CF_3	Bu-i
CH_2CF_3	Bu-c
CH_2CF_3	Bu-s
CH_2CF_3	Bu-t
CH_2CF_3	CH_2Ph
CH_2CF_3	CH(Me)Ph

R^{2a}	R^{1b}
$CHFCH_3$	Me
$CHFCH_3$	Et
$CHFCH_3$	Pr-n
$CHFCH_3$	Pr-i
$CHFCH_3$	Pr-c
$CHFCH_3$	Bu-n
$CHFCH_3$	Bu-i
$CHFCH_3$	Bu-c
$CHFCH_3$	Bu-s
$CHFCH_3$	Bu-t
$CHFCH_3$	CH_2Ph
$CHFCH_3$	CH(Me)Ph
CF_2CH_3	Me
CF_2CH_3	Et
CF_2CH_3	Pr-n
CF_2CH_3	Pr-i
CF_2CH_3	Pr-c
CF_2CH_3	Bu-n
CF_2CH_3	Bu-i
CF_2CH_3	Bu-c
CF_2CH_3	Bu-s
CF_2CH_3	Bu-t
CF_2CH_3	CH_2Ph
CF_2CH_3	CH(Me)Ph
$CF(CH_3)_2$	Me
$CF(CH_3)_2$	Et
$CF(CH_3)_2$	Pr-n
$CF(CH_3)_2$	Pr-i
$CF(CH_3)_2$	Pr-c
$CF(CH_3)_2$	Bu-n
$CF(CH_3)_2$	Bu-i
$CF(CH_3)_2$	Bu-c
$CF(CH_3)_2$	Bu-s
$CF(CH_3)_2$	Bu-t

[表26]

R^{2a}	R^{1b}
$CF(CH_3)_2$	CH_2Ph
$CF(CH_3)_2$	CH(Me)Ph
CF_2CF_2H	Me
CF_2CF_2H	Et
CF_2CF_2H	Pr-n
CF_2CF_2H	Pr-i
CF_2CF_2H	Pr-c
CF_2CF_2H	Bu-n
CF_2CF_2H	Bu-i
CF_2CF_2H	Bu-c
CF_2CF_2H	Bu-s
CF_2CF_2H	Bu-t
CF_2CF_2H	Pen-n
CF_2CF_2H	Pen-i
CF_2CF_2H	Pen-c
CF_2CF_2H	Pen-s
CF_2CF_2H	Pen-t
CF_2CF_2H	3-Pen
CF_2CF_2H	Hex-n
CF_2CF_2H	Hex-c
CF_2CF_2H	CH_2Ph
CF_2CF_2H	CH(Me)Ph
CF_2CF_2H	$(CH_2)_2Ph$
CF_2CF_2H	$(CH_2)_3Ph$
CF_2CF_3	Me
CF_2CF_3	Et
CF_2CF_3	Pr-n
CF_2CF_3	Pr-i
CF_2CF_3	Pr-c
CF_2CF_3	Bu-n
CF_2CF_3	Bu-i
CF_2CF_3	Bu-c
CF_2CF_3	Bu-s
CF_2CF_3	Bu-t

R^{2a}	R^{1b}
CF_2CF_3	Pen-n
CF_2CF_3	Pen-i
CF_2CF_3	Pen-c
CF_2CF_3	Pen-s
CF_2CF_3	Pen-t
CF_2CF_3	3-Pen
CF_2CF_3	Hex-n
CF_2CF_3	Hex-c
CF_2CF_3	CH_2Ph
CF_2CF_3	CH(Me)Ph
CF_2CF_3	$(CH_2)_2Ph$
CF_2CF_3	$(CH_2)_3Ph$
$CF_2CF_2CF_3$	Me
$CF_2CF_2CF_3$	Et
$CF_2CF_2CF_3$	Pr-n
$CF_2CF_2CF_3$	Pr-i
$CF_2CF_2CF_3$	Pr-c
$CF_2CF_2CF_3$	Bu-n
$CF_2CF_2CF_3$	Bu-i
$CF_2CF_2CF_3$	Bu-s
$CF_2CF_2CF_3$	Bu-t
$CF(CF_3)_2$	Me
$CF(CF_3)_2$	Et
$CF(CF_3)_2$	Pr-n
$CF(CF_3)_2$	Pr-i
$CF(CF_3)_2$	Pr-c
$CF(CF_3)_2$	Bu-n
$CF(CF_3)_2$	Bu-i
$CF(CF_3)_2$	Bu-s
$CF(CF_3)_2$	Bu-t

[0192] 本発明化合物は水田用の除草剤として、湛水下の土壌処理及び茎葉処理の

いずれの処理方法においても使用できる。水田雑草としては、例えば、ヒルムシロ（Ｐｏｔａｍｏｇｅｔｏｎ　ｄｉｓｔｉｎｃｔｕｓ）等に代表されるヒルムシロ科（Ｐｏｔａｍｏｇｅｔｏｎａｃｅａｅ）雑草、ヘラオモダカ（Ａｌｉｓｍａ　ｃａｎａｌｉｃｕｌａｔｕｍ）、ウリカワ（Ｓａｇｉｔｔａｒｉａ　ｐｙｇｍａｅａ）及びオモダカ（Ｓａｇｉｔｔａｒｉａ　ｔｒｉｆｏｌｉａ）等に代表されるオモダカ科（Ａｌｉｓｍａｔａｃｅａｅ）雑草、アゼガヤ（Ｌｅｐｔｏｃｈｌｏａ　ｃｈｉｎｅｎｓｉｓ）、イヌビエ（Ｅｃｈｉｎｏｃｈｌｏａ　ｃｒｕｓ－ｇａｌｌｉ）、タイヌビエ（Ｅｃｈｉｎｏｃｈｌｏａ　ｏｒｙｚｉｃｏｌａ）、アシカキ（Ｈｏｍａｌｏｃｅｎｃｈｒｕｓ　ｊａｐｏｎｏｃｕｓ）及びキシュウスズメノヒエ（Ｐａｓｐａｌｕｍ　ｄｉｓｔｉｃｈｕｍ）等に代表されるイネ科（Ｇｒａｍｉｎｅａｅ）雑草、クログワイ（Ｅｌｅｏｃｈａｒｉｓ　ｋｕｒｏｇｕｗａｉ）、ホタルイ（Ｓｃｉｒｐｕｓ　ｊｕｎｃｏｉｄｅｓ）、シズイ（Ｓｃｉｒｐｕｓ　ｎｉｐｐｏｎｉｃｕｓ）、ミズガヤツリ（Ｃｙｐｅｒｕｓ　ｓｅｒｏｔｉｎｕｓ）、タマガヤツリ（Ｃｙｐｅｒｕｓ　ｄｉｆｆｏｒｍｉｓ）及びヒナガヤツリ（Ｃｙｐｅｒｕｓ　ｈａｋｏｎｅｎｓｉｓ）等に代表されるカヤツリグサ科（Ｃｙｐｅｒａｃｅａｅ）雑草、ウキクサ（Ｓｐｉｒｏｄｅｌａ　ｐｏｌｙｒｈｉｚａ）及びアオウキクサ（Ｌｅｍｎａ　ｐａｕｃｉｃｏｓｔａｔａ）等に代表されるウキクサ科（Ｌｅｍｎａｃｅａｅ）雑草、イボクサ（Ｍｕｒｄａｎｎｉａ　ｋｅｉｓａｋ）等に代表されるツユクサ科（Ｃｏｍｍｅｌｉｎａｃｅａｅ）雑草、ミズアオイ（Ｍｏｎｏｃｈｏｒｉａ　ｋｏｒｓａｋｏｗｉｉ）及びコナギ（Ｍｏｎｏｃｈｏｒｉａ　ｖａｇｉｎａｌｉｓ）等に代表されるミズアオイ科（Ｐｏｎｔｅｄｅｒｉａｃｅａｅ）雑草、ミゾハコベ（Ｅｌａｔｉｎｅ　ｔｒｉａｎｄｒａ）等に代表されるミゾハコベ科（Ｅｌａｔｉｎａｃｅａｅ）雑草、ヒメミソハギ（Ａｍｍａｎｎｉａ　ｍｕｌｔｉｆｌｏｒａ）及びキカシグサ（Ｒｏｔａｌａ　ｉｎｄｉｃａ）等に代表されるミソハギ科（Ｌｙｔｈｒａｃｅａｅ）雑草、チョウジタデ（Ｌｉｄｗｉｇｉａ　ｅｐｉｌｏｂｉｏｉｄｅｓ）等に代表されるアカバナ科（Ｏｅｎｏｔ

heraceae）雑草、アブノメ（Dopatrium junceum）、オオアブノメ（Gratiola japonica）、キクモ（Limnophila sessilifolia）、アゼナ（Lindernia pyxidaria）及びアメリカアゼナ（Lindernia dubia）等に代表されるゴマノハグサ科（Scrophulariaceae）雑草、クサネム（Aeschynomene indica）等に代表されるマメ科（Leguminosae）雑草、並びにアメリカセンダングサ（Bidens frondosa）及びタウコギ（Bidens tripartita）等に代表されるキク科（Compositae）雑草等が挙げられる。

[0193] また、本発明化合物は、畑地及び果樹園用の除草剤として、土壌処理、土壌混和処理及び茎葉処理のいずれの処理方法においても使用できる。畑地雑草としては、例えば、イヌホウズキ（Solanum nigrum）及びチョウセンアサガオ（Datura stramonium）等に代表されるナス科（Solanaceae）雑草、アメリカフウロ(Granium carolinianum)等に代表されるフウロソウ科（Geraniaceae）雑草、イチビ（Abutilon theophrasti）及びアメリカキンゴジカ（Sida spinosa）等に代表されるアオイ科（Malvaceae）雑草、マルバアサガオ（Ipomoea purpurea）等のアサガオ類（Ipomoea spps.）及びヒルガオ類（Calystegia spps.）等に代表されるヒルガオ科（Convolvulaceae）雑草、イヌビユ（Amaranthus lividus）及びアオビユ（Amaranthus retroflexus）等に代表されるヒユ科（Amaranthaceae）雑草、オナモミ（xanthium pensylvanicum）、ブタクサ（Ambrosia artemisiaefolia）、ヒマワリ（Helianthus annuus）、ハキダメギク（Galinsoga ciliata）、セイヨウトゲアザミ（Cirsium arvense）、ノボロギ

ク（Ｓｅｎｅｃｉｏ ｖｕｌｇａｒｉｓ）及びヒメジョン（Ｅｒｉｇｅｒｏｎ ａｎｎｕｓ）等に代表されるキク科（Ｃｏｍｐｏｓｉｔａｅ）雑草、イメガラシ（Ｒｏｒｉｐｐａ ｉｎｄｉｃａ）、ノハラガラシ（Ｓｉｎａｐｉｓ ａｒｖｅｎｓｉｓ）及びナズナ（Ｃａｐｓｅｌｌａ Ｂｕｒｓａｐａｓｔｏｒｉｓ）等に代表されるアブラナ科（Ｃｒｕｃｉｆｅｒａｅ）雑草、イメタデ（Ｐｏｌｙｇｏｎｕｍ Ｂｌｕｍｅｉ）及びソバカズラ（Ｐｏｌｙｇｏｎｕｍ ｃｏｎｖｏｌｖｕｌｕｓ）等に代表されるタデ科（Ｐｏｌｙｇｏｎａｃｅａｅ）雑草、スベリヒユ（Ｐｏｒｔｕｌａｃａ ｏｌｅｒａｃｅａ）等に代表されるスベリヒユ科（Ｐｏｒｔｕｌａｃａｃｅａｅ）雑草、シロザ（Ｃｈｅｎｏｐｏｄｉｕｍ ａｌｂｕｍ）、コアカザ（Ｃｈｅｎｏｐｏｄｉｕｍ ｆｉｃｉｆｏｌｉｕｍ）及びホウキギ（Ｋｏｃｈｉａ ｓｃｏｐａｒｉａ）等に代表されるアカザ科（Ｃｈｅｎｏｐｏｄｉａｃｅａｅ）雑草、ハコベ（Ｓｔｅｌｌａｒｉａ ｍｅｄｉａ）等に代表されるナデシコ科（Ｃａｒｙｏｐｈｙｌｌａｃｅａｅ）雑草、オオイヌノフグリ（Ｖｅｒｏｎｉｃａ ｐｅｒｓｉｃａ）等に代表されるゴマノハグサ科（Ｓｃｒｏｐｈｕｌａｒｉａｃｅａｅ）雑草、ツユクサ（Ｃｏｍｍｅｌｉｎａ ｃｏｍｍｕｎｉｓ）等に代表されるツユクサ科（Ｃｏｍｍｅｌｉｎａｃｅａｅ）雑草、ホトケノザ（Ｌａｍｉｕｍ ａｍｐｌｅｘｉｃａｕｌｅ）及びヒメオドリコソウ（Ｌａｍｉｕｍ ｐｕｒｐｕｒｅｕｍ）等に代表されるシソ科（Ｌａｂｉａｔａｅ）雑草、コニシキソウ（Ｅｕｐｈｏｒｂｉａ ｓｕｐｉｎａ）及びオオニシキソウ（Ｅｕｐｈｏｒｂｉａ ｍａｃｕｌａｔａ）等に代表されるトウダイグサ科（Ｅｕｐｈｏｒｂｉａｃｅａｅ）雑草、ヤエムグラ（Ｇａｌｉｕｍ ｓｐｕｒｉｕｍ）及びアカネ（Ｒｕｂｉａ ａｋａｎｅ）等に代表されるアカネ科（Ｒｕｂｉａｃｅａｅ）雑草、スミレ（Ｖｉｏｌａ ｍａｎｄｓｈｕｒｉｃａ）等に代表されるスミレ科（Ｖｉｏｌａｃｅａｅ）雑草並びにアメリカツノクサネム（Ｓｅｓｂａｎｉａ ｅｘａｌｔａｔａ）及びエビスグサ（Ｃａｓｓｉａ ｏｂｔｕｓｉｆｏｌｉａ）等に代表されるマメ科（Ｌｅｇｕｍｉｎｏｓａｅ）雑草、カタバミ（Ｏｘａｌｉｓ ｃｏｕｒｎｉｃ

ｕｌａｔａ）に代表されるカタバミ科（Ｏｘｓａｌｄａｓｅａｅ）等の広葉雑草（Ｂｒｏａｄ－ｌｅａｖｅｄ　ｗｅｅｄｓ）。野生ソルガム（Ｓｏｒｇｈａｍ　ｂｉｃｏｌｏｒ）、オオクサキビ（Ｐａｎｉｃｕｍ　ｄｉｃｈｏｔｏｍｉｆｌｏｒｕｍ）、ジョンソングラス（Ｓｏｒｇｈｕｍ　ｈａｌｅｐｅｎｓｅ）、イヌビエ（Ｅｃｈｉｎｏｃｈｌｏａ　ｃｒｕｓ－ｇａｌｌｉ　ｖａｒ．　ｃｒｕｓ－ｇａｌｌｉ）、ヒメイヌビエ（Ｅｃｈｉｎｏｃｈｌｏａ　ｃｒｕｓ－ｇａｌｌｉ　ｖａｒ．　ｐｒａｔｉｃｏｌａ）、栽培ビエ（Ｅｃｈｉｎｏｃｈｌｏａ　ｕｔｉｌｉｓ）、メヒシバ（Ｄｉｇｉｔａｒｉａ　ｃｉｌｉａｒｉｓ）、カラスムギ（Ａｖｅｎａ　ｆａｔｕａ）、ブラックグラス（Ａｌｏｐｅｃｕｒｕｓ　ｍｙｏｓｕｒｏｉｄｅｓ）、オヒシバ（Ｅｌｅｕｓｉｎｅ　ｉｎｄｉｃａ）、エノコログサ（Ｓｅｔａｒｉａ　ｖｉｒｉｄｉｓ）、アキノエノコログサ（Ｓｅｔａｒｉａ　ｆａｂｅｒｉ）及びスズメノテッポウ（Ａｌｏｐｅｃｕｒｕｓ　ａｅｇｕａｌｉｓ）等に代表されるイネ科雑草（Ｇｒａｍｉｎａｃｅｏｕｓ　ｗｅｅｄｓ）並びにハマスゲ（Ｃｙｐｅｒｕｓ　ｒｏｔｕｎｄｕｓ，Ｃｙｐｅｒｕｓ　ｅｓｃｕｌｅｎｔｕｓ）等に代表されるカヤツリグサ科雑草（Ｃｙｐｅｒａｃｅｏｕｓ　ｗｅｅｄｓ）等が挙げられる。

[0194] また、本発明化合物は、水田、畑地及び果樹園等の農園芸分野以外に芝地、運動場、空地、道路脇、及び線路端等非農耕地において、土壌処理、土壌混和処理及び茎葉処理のいずれの処理方法においても使用できる。その雑草としては、畑地及び果樹園用雑草で述べたものに加えて、スズメノカタビラ（Ｐｏａ　ａｎｎｕａ）、セイヨウタンポポ（Ｔａｒａｘａｃｕｍ　ｏｆｆｉｃｉｎａｌｅ）、オオアレチノギク（Ｃｏｎｙｚａ　ｓｕｍａｔｒｅｎｓｉｓ）、タネツケバナ（Ｃａｒｄａｍｉｎｅ　ｆｌｅｘｕｏｓａ）、シロツメクサ（Ｔｒｉｆｏｌｉｕｍ　ｒｅｐｅｎｓ）、チドメグサ（Ｈｙｄｒｏｃｏｔｙｌｅ　ｓｉｂｔｈｏｒｐｉｏｉｄｅｓ）、オオバコ（Ｐｌａｎｔａｇｏ　ａｓｉａｔｉｃａ）、ヒメクグ（Ｃｙｐｅｒｕｓ　ｂｒｅｖｉｆｏｌｉｕｓ、Ｋｙｌｌｉｎｇａ　ｂｒｅｖｉｆｏｌｉａ）、スギナ（Ｅｑｕｉｓｅｔｕｍ　ａｒ

ｖｅｎｓｅ）等が挙げられる。

[0195] 本発明化合物を除草剤として施用するにあたっては、通常適当な固体担体又は液体担体と混合し、更に所望により界面活性剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止剤、崩壊剤及び分解防止剤等を添加して、水和剤、乳剤、フロアブル剤、ドライフロアブル剤、液剤、粉剤、粒剤又はゲル剤等任意の剤型の製剤にて実用に供することができる。また、省力化及び安全性向上の観点から、上記任意の剤型の製剤を水溶性包装体に封入して供することもできる。

[0196] 固体担体としては、例えば石英、カオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライト及び珪藻土等の天然鉱物質類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウム及び塩化カリウム等の無機塩類、合成珪酸並びに合成珪酸塩が挙げられる。

[0197] 液体担体としては、例えばエチレングリコール、プロピレングリコール及びイソプロパノール等のアルコール類、キシレン、アルキルベンゼン及びアルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ブチルセロソルブ等のエーテル類、シクロヘキサノン等のケトン類、γ－ブチロラクトン等のエステル類、Ｎ－メチルピロリドン、Ｎ－オクチルピロリドン等の酸アミド類、大豆油、ナタネ油、綿実油及びヒマシ油等の植物油並びに水が挙げられる。

これら固体及び液体担体は、単独で用いても２種以上を併用してもよい。

[0198] 界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステル及びポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル等のノニオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナ

フタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸及び燐酸塩、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸及び燐酸塩、ポリカルボン酸塩及びポリスチレンスルホン酸塩等のアニオン性界面活性剤、アルキルアミン塩及びアルキル４級アンモニウム塩等のカチオン性界面活性剤並びにアミノ酸型及びベタイン型等の両性界面活性剤が挙げられる。

[0199] これら界面活性剤の含有量は、特に限定されるものではないが、本発明の製剤１００重量部に対し、通常０．０５から２０重量部の範囲が望ましい。また、これら界面活性剤は、単独で用いても２種以上を併用してもよい。

本発明化合物は必要に応じて製剤又は散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤又は共力剤等と混合施用してもよい。

特に、他の除草剤と混合施用することにより、施用薬量の減少による低コスト化、混合薬剤の相乗作用による殺草スペクトラムの拡大や、より高い殺草効果が期待できる。この際、同時に複数の公知除草剤との組み合わせも可能である。

[0200] 本発明化合物と混合使用されるのに好ましい除草剤としては、例えば、アセトクロール（ａｃｅｔｏｃｈｌｏｒ／一般名）、アシフルオルフェン（ａｃｉｆｌｕｏｒｆｅｎ／一般名）、アクロニフェン（ａｃｌｏｎｉｆｅｎ／一般名）、アラクロール（ａｌａｃｈｌｏｒ／一般名）、アロキシジム（ａｌｌｏｘｙｄｉｍ／一般名）、アロキシジムナトリウム（ａｌｌｏｘｙｄｉｍ－ｓｏｄｉｕｍ／一般名）、アメトリン（ａｍｅｔｒｙｎ／一般名）、アミカルバゾン（ａｍｉｃａｒｂａｚｏｎｅ／一般名）、アミドスルフロン（ａｍｉｄｏｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、アミノシクロピラクロール（ａｍｉｎｏｃｙｃｌｏｐｉｒａｃｈｌｏｒ／一般名）、アミノシクロピラクロールの塩およびエステル（ａｍｉｎｏｃｙｃｌｏｐｉｒａｃｈｌｏｒ－ｓａｌｔｓ ａｎｄ ｅｓｔｅｒｓ）、アミノピラリド（ａｍｉｎｏｐｙｒａｌｉｄ／一般名）、アミノピラリドの塩およびエステル（ａｍｉｎｏｐｙｒａｌｉｄ－ｓａｌｔｓ ａｎｄ ｅｓｔｅｒｓ）、アミプロホスメチル（ａｍｉｐｒ

ｏｐｈｏｓ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、アミトロール（ａｍｉｔｒｏｌ／一般名）、アニロホス（ａｎｉｌｏｆｏｓ／一般名）、アシュラム（ａｓｕｌａｍ／一般名）、アトラジン（ａｔｒａｚｉｎｅ／一般名）、アザフェニジン（ａｚａｆｅｎｉｄｉｎ／一般名）、アジムスルフロン（ａｚｉｍｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、ベフルブタミド（ｂｅｆｌｕｂｕｔａｍｉｄ／一般名）、ベナゾリンエチル（ｂｅｎａｚｏｌｉｎ－ｅｔｈｙｌ／一般名）、ベンカルバゾン（ｂｅｎｃａｒｂａｚｏｎｅ／一般名）、ベンフルラリン（ｂｅｎｆｌｕｒａｌｉｎ、ｂｅｎｅｆｉｎ／一般名）、ベンフレセート（ｂｅｎｆｕｒｅｓａｔｅ／一般名）、ベンスルフロンメチル（ｂｅｎｓｕｌｆｕｒｏｎ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、ベンスリド（ｂｅｎｓｕｌｉｄｅ／一般名）、ベンタゾン（ｂｅｎｔａｚｏｎｅ／一般名）、ベンタゾンナトリウム（ｂｅｎｔａｚｏｎｅ－ｓｏｄｉｕｍ／一般名）、ベンタゾンの塩（ｂｅｎｔａｚｏｎｅ－ｓａｌｔｓ）、ベンチオカーブ（ｂｅｎｔｈｉｏｃａｒｂ／一般名）、ベンズフェンジゾン（ｂｅｎｚｆｅｎｄｉｚｏｎｅ／一般名）、ベンゾビシクロン（ｂｅｎｚｏｂｉｃｙｃｌｏｎ／一般名）、ベンゾフェナップ（ｂｅｎｚｏｆｅｎａｐ／一般名）、ビアラホス（ｂｉａｌａｐｈｏｓ／一般名）、ビアラホスナトリウム（ｂｉａｌａｐｈｏｓ－ｓｏｄｉｕｍ／一般名）、ビシクロピロン（ｂｉｃｙｃｌｏｐｙｒｏｎｅ／一般名）、ビフェノックス（ｂｉｆｅｎｏｘ／一般名）、ビスピリバック（ｂｉｓｐｙｒｉｂａｃ／一般名）、ビスピリバックナトリウム（ｂｉｓｐｙｒｉｂａｃ－ｓｏｄｉｕｍ／一般名）、ブロマシル（ｂｒｏｍａｃｉｌ／一般名）、ブロモブチド（ｂｒｏｍｏｂｕｔｉｄｅ／一般名）、ブロモフェノキシム（ｂｒｏｍｏｆｅｎｏｘｉｍ／一般名）、ブロモキシニル（ｂｒｏｍｏｘｙｎｉｌ／一般名）、ブロモキシニルの塩およびエステル（ｂｒｏｍｏｘｙｎｉｌ－ｓａｌｔｓ　ａｎｄ　ｅｓｔｅｒｓ）、ブタクロール（ｂｕｔａｃｈｌｏｒ／一般名）、ブタフェナシル（ｂｕｔａｆｅｎａｃｉｌ／一般名）、ブタミホス（ｂｕｔａｍｉｆｏｓ／一般名）、ブテナクロール（ｂｕｔｅｎａｃｈｌｏｒ／一般名）、ブトラリン（ｂｕｔｒａｌｉｎ／一般名）、ブトロキシジ

ム（ｂｕｔｒｏｘｙｄｉｍ／一般名）、ブチレート（ｂｕｔｙｌａｔｅ／一般名）、カフエンストロール（ｃａｆｅｎｓｔｒｏｌｅ／一般名）、カルベタミド（ｃａｒｂｅｔａｍｉｄｅ／一般名）、カルフエントラゾンエチル（ｃａｒｆｅｎｔｒａｚｏｎｅ－ｅｔｈｙｌ）、クロメトキシフエン（ｃｈｌｏｍｅｔｈｏｘｙｆｅｎ／一般名）、クロメトキシニル（ｃｈｌｏｍｅｔｈｏｘｙｎｉｌ／一般名）、クロランベン（ｃｈｌｏｒａｍｂｅｎ／一般名）、クロランベンの塩およびエステル（ｃｈｌｏｒａｍｂｅｎ－ｓａｌｔｓ　ａｎｄ　ｅｓｔｅｒｓ）、クロランスラムメチル（ｃｈｌｏｒａｎｓｕｌａｍ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、クロルフルレノールメチル（ｃｈｌｏｒｆｌｕｒｅｎｏｌ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、クロリダゾン（ｃｈｌｏｒｉｄａｚｏｎ／一般名）、クロリムロンエチル（ｃｈｌｏｒｉｍｕｒｏｎ－ｅｔｈｙｌ／一般名）、クロロブロムロン（ｃｈｌｏｒｏｂｒｏｍｕｒｏｎ／一般名）、クロロトルロン（ｃｈｌｏｒｏｔｏｌｕｒｏｎ／一般名）、クロロクスロン（ｃｈｌｏｒｏｘｕｒｏｎ／一般名）、クロルフタリム（ｃｈｌｏｒｐｈｔａｌｉｍ／一般名）、クロルプロファム（ｃｈｌｏｒｐｒｏｐｈａｍ／一般名）、クロロＩＰＣ（ｃｈｌｏｒｐｒｏｐｈａｍ／一般名）、クロルスルフロン（ｃｈｌｏｒｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、クロルタルジメチル（ｃｈｌｏｒｔｈａｌ－ｄｉｍｅｔｈｙｌ／一般名）、クロルチアミド（ｃｈｌｏｒｔｈｉａｍｉｄ／一般名）、シニドンエチル（ｃｉｎｉｄｏｎ－ｅｔｈｙｌ／一般名）、シンメスリン（ｃｉｎｍｅｔｈｙｌｉｎ／一般名）、シノスルフロン（ｃｉｎｏｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、クレトジム（ｃｌｅｔｈｏｄｉｍ／一般名）、クロジナホップ（ｃｌｏｄｉｎａｆｏｐ／一般名）、クロジナホッププロパルギル（ｃｌｏｄｉｎａｆｏｐ－ｐｒｏｐａｒｇｙｌ／一般名）、クロマゾン（ｃｌｏｍａｚｏｎｅ／一般名）、クロメプロップ（ｃｌｏｍｅｐｒｏｐ／一般名）、クロピラリド（ｃｌｏｐｙｒａｌｉｄ／一般名）、クロピラリドの塩およびエステル（ｃｌｏｐｙｒａｌｉｄ－ｓａｌｔｓ　ａｎｄ　ｅｓｔｅｒｓ）、ＣＮＰ（一般名）、クミルロン（ｃｕｍｙｌｕｒｏｎ／一般名）、シアナジン（ｃｙａｎａｚｉｎ／一般名）

、シクロエート（ｃｙｃｌｏａｔｅ／一般名）、シクロピリモレート（ｃｙｃｌｏｐｙｒｉｍｏｒａｔｅ／一般名、ＳＷ－０６５／試験名）、シクロスルファムロン（ｃｙｃｌｏｓｕｌｆａｍｕｒｏｎ／一般名）、シクロキシジム（ｃｙｃｌｏｘｙｄｉｍ／一般名）、シハロホップブチル（ｃｙｈａｌｏｆｏｐ－ｂｕｔｙｌ／一般名）、ＤＡＨ－５００（試験名）、ダラポン（ｄａｌａｐｏｎ／一般名）、ダゾメット（ｄａｚｏｍｅｔ／一般名）、デスメディファム（ｄｅｓｍｅｄｉｐｈａｍ／一般名）、デスメトリン（ｄｅｓｍｅｔｒｙｎ／一般名）、ダイカンバ（ｄｉｃａｍｂａ／一般名）、ダイカンバの塩およびエステル（ｄｉｃａｍｂａ－ｓａｌｔｓ　ａｎｄ　ｅｓｔｅｒｓ）、ジクロベニル（ｄｉｃｈｌｏｂｅｎｉｌ／一般名）、ジクロホップ（ｄｉｃｌｏｆｏｐ／一般名）、ジクロホップメチル（ｄｉｃｌｏｆｏｐ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、ジクロルプロップ（ｄｉｃｈｌｏｒｐｒｏｐ／一般名）、ジクロルプロップの塩およびエステル（ｄｉｃｈｌｏｒｐｒｏｐ－ｓａｌｔｓ　ａｎｄ　ｅｓｔｅｒｓ）、Ｐジクロルプロップ（ｄｉｃｈｌｏｒｐｒｏｐ－Ｐ／一般名）、Ｐジクロルプロップの塩およびエステル（ｄｉｃｈｌｏｒｐｒｏｐ－Ｐ－ｓａｌｔｓ　ａｎｄ　ｅｓｔｅｒｓ）、ジクロスラム（ｄｉｃｌｏｓｕｌａｍ／一般名）、ジフエンゾコート（ｄｉｆｅｎｚｏｑｕａｔ／一般名）、ジフルフエニカン（ｄｉｆｌｕｆｅｎｉｃａｎ／一般名）、ジフルフエンゾピル（ｄｉｆｌｕｆｅｎｚｏｐｙｒ／一般名）、ジフルフェンゾピルナトリウム（ｄｉｆｌｕｆｅｎｚｏｐｙｒ－ｓｏｄｉｕｍ／一般名）、ジメピペレート（ｄｉｍｅｐｉｐｅｒａｔｅ／一般名）、ジメタメトリン（ｄｉｍｅｔｈａｍｅｔｒｙｎ／一般名）、ジメタクロール（ｄｉｍｅｔｈａｃｈｌｏｒ／一般名）、ジメテナミド（ｄｉｍｅｔｈｅｎａｍｉｄ／一般名）、Ｐジメテナミド（ｄｉｍｅｔｈｅｎａｍｉｄ－ｐ／一般名）、ジメシピン（ｄｉｍｅｔｈｉｐｉｎ／一般名）、ジニトロアミン（ｄｉｎｉｔｒａｍｉｎｅ／一般名）、ジノセブ（ｄｉｎｏｓｅｂ／一般名）、ジノテルブ（ｄｉｎｏｔｅｒｂ／一般名）、ＤＮＯＣ／一般名、ジフェナミド（ｄｉｐｈｅｎａｍｉｄ／一般名）、ジクワット（ｄｉｑｕａｔ／一般名）、ジ

チオビル（ｄｉｔｈｉｏｐｙｌ／一般名）、ジウロン（ｄｉｕｒｏｎ／一般名）、ＤＳＭＡ／一般名、ダイムロン（ｄｙｍｒｏｎ／一般名）、エンドタール（ｅｎｄｏｔｈａｌ／一般名）、ＥＰＴＣ／一般名、エスプロカルブ（ｅｓｐｒｏｃａｒｂ／一般名）、エタルフルラリン（ｅｔｈａｌｆｌｕｒａｌｉｎ／一般名）、エタメトスルフロンメチル（ｅｔｈａｍｅｔｓｕｌｆｕｒｏｎ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、エトフメセート（ｅｔｈｏｆｕｍｅｓａｔｅ／一般名）、エトベンザニド（ｅｔｏｂｅｎｚａｎｉｄ／一般名）、エトキシスルフロン（ｅｔｈｏｘｙｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、フラザスルフロン（ｆｌａｚａｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、フェノキサプロップ（ｆｅｎｏｘａｐｒｏｐ／一般名）、フェノキサプロップエチル（ｆｅｎｏｘａｐｒｏｐ－ｅｔｈｙｌ／一般名）、フェノキサスルホン（ｆｅｎｏｘａｓｕｌｆｏｎｅ／一般名）、フェンキノトリオン（ｆｅｎｑｕｉｏｎｏｔｒｉｏｎ／一般名）、フェントラザミド（ｆｅｎｔｒａｚａｍｉｄｅ／一般名）、フラムプロップ（ｆｌａｍｐｒｏｐ／一般名）、フラザスルフロン（ｆｌａｚａｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、フロラスラム（ｆｌｏｒａｓｕｌａｍ／一般名）、フルアジホップ（ｆｌｕａｚｉｆｏｐ／一般名）、フルアジホップブチル（ｆｌｕａｚｉｆｏｐ－ｂｕｔｙｌ／一般名）、フルアゾレート（ｆｌｕａｚｏｌａｔｅ／一般名）、フルカルバゾンナトリウム（ｆｌｕｃａｒｂａｚｏｎｅ－ｓｏｄｉｕｍ／一般名）、フルセトスルフロン(ｆｌｕｃｅｔｏｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名)、フルクロラリン（ｆｌｕｃｌｏｒａｌｉｎ／一般名）、フルフェナセット（ｆｌｕｆｅｎａｃｅｔ／一般名）、フルフェンピルエチル（ｆｌｕｆｅｎｐｙｌ－ｅｔｈｙｌ／一般名）、フルメツラム（ｆｌｕｍｅｔｓｕｌａｍ／一般名）、フルミクロラックペンチル（ｆｌｕｍｉｃｌｏｒａｃ－ｐｅｎｔｙｌ／一般名）、フルミオキサジン（ｆｌｕｍｉｏｘａｚｉｎ／一般名）、フルオメツロン（ｆｌｕｏｍｅｔｕｒｏｎ／一般名）、フルオログリコフェンエチル（ｆｌｕｏｒｏｇｌｙｃｏｆｅｎ－ｅｔｈｙｌ／一般名）、フルピルスルフロン（ｆｌｕｐｙｒｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、フルポキサム（ｆｌｕｐｏｘａｍ／一般名）、フルレノール

（ｆｌｕｒｅｎｏｌ／一般名）、フルリドン（ｆｌｕｒｉｄｏｎｅ／一般名）、フルロクロリドン（ｆｌｕｒｏｃｈｌｏｒｉｄｏｎｅ／一般名）、フルロキシピル（ｆｌｕｒｏｘｙｐｙｒ／一般名）、フルロキシピルのエステル（ｆｌｕｒｏｘｙｐｙｒ－ｅｓｔｅｒｓ）、フルプリミドール（ｆｌｕｒｐｒｉｍｉｄｏｌ／一般名）、フルタモン（ｆｌｕｒｔａｍｏｎｅ／一般名）、フルチアセットメチル（ｆｌｕｔｈｉａｃｅｔ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、フォメサフェン（ｆｏｍｅｓａｆｅｎ／一般名）、フォラムスルフロン（ｆｏｒａｍｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、フォサミン（ｆｏｓａｍｉｎｅ／一般名）、グルホシネート（ｇｌｕｆｏｓｉｎａｔｅ／一般名）、グルホシネートアンモニウム（ｇｌｕｆｏｓｉｎａｔｅ－ａｍｍｏｎｉｕｍ／一般名）、グリホサート（ｇｌｙｐｈｏｓａｔｅ／一般名）、グリホサートアンモニウム（ｇｌｙｐｈｏｓａｔｅ－ａｍｍｏｎｉｕｍ／一般名）、グリホサートイソプロピルアミン（ｇｌｙｐｈｏｓａｔｅ－ｉｓｏ－ｐｒｏｐｙｌａｍｍｏｎｉｕｍ／一般名）、グリホサートカリウム（ｇｌｙｐｈｏｓａｔｅ－ｐｏｔａｓｓｉｕｍ／一般名）、グリホサートナトリウム（ｇｌｙｐｈｏｓａｔｅ－ｓｏｄｉｕｍ／一般名）、グリホサートトリメシウム（ｇｌｙｐｈｏｓａｔｅ－ｔｒｉｍｅｓｉｕｍ／一般名）、ハロウキシフェン（ｈａｌａｕｘｉｆｅｎ／一般名）、ハロウキシフェンの塩およびエステル（ｈａｌａｕｘｉｆｅｎ－ｓａｌｔｓ　ａｎｄ　ｅｓｔｅｒｓ）、ハロサフェン（ｈａｌｏｓａｆｅｎ／一般名）、ハロスルフロン（ｈａｌｏｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、ハロスルフロンメチル（ｈａｌｏｓｕｌｆｕｒｏｎ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、ハロキシホップ（ｈａｌｏｘｙｆｏｐ／一般名）、ハロキシホップメチル（ｈａｌｏｘｙｆｏｐ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、ヘキサジノン（ｈｅｘａｚｉｎｏｎｅ／一般名）、イマザメタベンズメチル（ｉｍａｚａｍｅｔｈａｂｅｎｚ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、イマザモックス（ｉｍａｚａｍｏｘ／一般名）、イマザピク（ｉｍａｚａｐｉｃ／一般名）、イマザピル（ｉｍａｚａｐｙｒ／一般名）、イマゼタピル（ｉｍａｚｅｔｈａｐｙｒ／一般名）、イマザキン（ｉｍａｚａ

ｑｕｉｎ／一般名）、イマゾスルフロン（ｉｍａｚｏｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、インダノファン（ｉｎｄａｎｏｆａｎ／一般名）、インダジフラム（ｉｎｄａｚｉｆｌａｍ／一般名）、ヨードスルフロンメチルナトリウム（ｉｏｄｏｓｕｌｆｕｒｏｎ－ｍｅｔｈｙｌ－ｓｏｄｉｕｍ／一般名）、アイオキシニル（ｉｏｘｙｎｉｌ　ｏｃｔａｎｏａｔｅ／一般名）、アイオキシニルの塩およびエステル（ｉｏｘｙｎｉｌ－ｓａｌｔｓ　ａｎｄ　ｅｓｔｅｒｓ）、イプフェンカルバゾン（ｉｐｆｅｎｃａｒｂａｚｏｎｅ／一般名）、イソプロチュロン（ｉｓｏｐｒｏｔｕｒｏｎ／一般名）、イソウロン（ｉｓｏｕｒｏｎ／一般名）、イソキサベン（ｉｓｏｘａｂｅｎ／一般名）、イソキサフルトール（ｉｓｏｘａｆｌｕｔｏｌｅ／一般名）、カルブチレート（ｋａｒｂｕｔｉｌａｔｅ／一般名）、ラクトフェン（ｌａｃｔｏｆｅｎ／一般名）、レナシル（ｌｅｎａｃｉｌ／一般名）、リニュロン（ｌｉｎｕｒｏｎ／一般名）、マレイン酸ヒドラジド（ｍａｌｅｉｃ　ｈｙｄｒａｚｉｄｅ／一般名）、ＭＣＰＡ（一般名）、ＭＣＰＡの塩およびエステル（ＭＣＰＡ－ｓａｌｔｓ　ａｎｄ　ｅｓｔｅｒｓ）、ＭＣＰＢ（一般名）、ＭＣＰＢの塩およびエステル（ＭＣＰＢ－ｓａｌｔｓ　ａｎｄ　ｅｓｔｅｒｓ）、メコプロップ（ｍｅｃｏｐｒｏｐ、ＭＣＰＰ／一般名）、メコプロップの塩およびエステル（ｍｅｃｏｐｒｏｐ－ｓａｌｔｓ　ａｎｄ　ｅｓｔｅｒｓ）、Ｐメコプロップ（ｍｅｃｏｐｒｏｐ－Ｐ、ＭＣＰＰ－Ｐ／一般名）、Ｐメコプロップの塩およびエステル（ｍｅｃｏｐｒｏｐ－Ｐ－ｓａｌｔｓ　ａｎｄ　ｅｓｔｅｒｓ）、メフェナセット（ｍｅｆｅｎａｃｅｔ／一般名）、メフルイジド（ｍｅｆｌｕｉｄｉｄｅ／一般名）、メソスルフロンメチル（ｍｅｓｏｓｕｌｆｕｒｏｎ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、メソトリオン（ｍｅｓｏｔｒｉｏｎｅ／一般名）、メタム（ｍｅｔａｍ／一般名）、メタミホップ（ｍｅｔａｍｉｆｏｐ／一般名）、メタミトロン（ｍｅｔａｍｉｔｒｏｎ／一般名）、メタザクロール（ｍｅｔａｚａｃｈｌｏｒ／一般名）、メタベンズチアズロン（ｍｅｔｈａｂｅｎｚｔｈｉａｚｕｒｏｎ／一般名）、メタゾスルフロン（ｍｅｔａｚｏｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、メチオゾリン（ｍｅ

ｔｈｉｏｚｏｌｉｎ／一般名）、メチルアジド（ｍｅｔｈｙｌ　ａｚｉｄｅ／一般名）、臭化メチル（ｍｅｔｈｙｌ　ｂｒｏｍｉｄｅ／一般名）、メチルダイムロン（ｍｅｔｈｙｌ　ｄｙｍｒｏｎ／一般名）、ヨウ化メチル（ｍｅｔｈｙｌ　ｉｏｄｉｄｅ／一般名）、メトベンズロン（ｍｅｔｏｂｅｎｚｕｒｏｎ／一般名）、メトラクロール（ｍｅｔｏｌａｃｈｌｏｒ／一般名）、Ｓメトラクロール（ｍｅｔｏｌａｃｈｌｏｒ－Ｓ／一般名）、メトスラム（ｍｅｔｏｓｕｌａｍ／一般名）、メトリブジン（ｍｅｔｒｉｂｕｚｉｎ／一般名）、メトスルフロンメチル（ｍｅｔｓｕｌｆｕｒｏｎ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、メトクスロン（ｍｅｔｏｘｕｒｏｎ／一般名）、モリネート（ｍｏｌｉｎａｔｅ／一般名）、モノリニュロン（ｍｏｎｏｌｉｎｕｒｏｎ／一般名）、モノスルフロン（ｍｏｎｏｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、モノスルフロンメチル（ｍｏｎｏｓｕｌｆｕｒｏｎ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、ＭＳＭＡ／一般名、ナプロアニリド（ｎａｐｒｏａｎｉｌｉｄｅ／一般名）、ナプロパミド（ｎａｐｒｏｐａｍｉｄｅ／一般名）、ナプタラム（ｎａｐｔａｌａｍ／一般名）、ナプタラムナトリウム（ｎａｐｔａｌａｍ－ｓｏｄｉｕｍ／一般名）、ネブロン（ｎｅｂｕｒｏｎ／一般名）、ニコスルフロン（ｎｉｃｏｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、ノルフルラゾン（ｎｏｒｆｌｕｒａｚｏｎ／一般名）、ＯＫ－７０１（試験名）、オレイン酸（ｏｌｅｉｃ　ａｃｉｄ／一般名）、オルベンカーブ（ｏｒｂｅｎｃａｒｂ／一般名）、オルソスルファムロン（ｏｒｔｈｏｓｕｌｆａｍｕｒｏｎ／一般名）、オリザリン（ｏｒｙｚａｌｉｎ／一般名）、オキサジアルギル（ｏｘａｄｉａｒｇｙｌ／一般名）、オキサジアゾン（ｏｘａｄｉａｚｏｎ／一般名）、オキサスルフロン（ｏｘａｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、オキサジクロメホン（ｏｘａｚｉｃｌｏｍｅｆｏｎｅ／一般名）、オキシフルオルフェン（ｏｘｙｆｌｕｏｒｆｅｎ／一般名）、パラコート（ｐａｒａｑｕａｔ／一般名）、ペラルゴン酸（ｐｅｌａｒｇｏｎｉｃａｃｉｄ／一般名）、ペンディメタリン（ｐｅｎｄｉｍｅｔｈａｌｉｎ／一般名）、ペノキススラム（ｐｅｎｏｘｓｕｌａｍ／一般名）、ペンタノクロール（ｐｅｎｔａｎｏｃｈｌｏｒ／一般名

）、ペントキサゾン（ｐｅｎｔｏｘａｚｏｎｅ／一般名）、ペトキサミド（ｐｅｔｈｏｘａｍｉｄ／一般名）、フエンメディファムエチル（ｐｈｅｎｍｅｄｉｐｈａｍ－ｅｔｈｙｌ／一般名）、ピクロラム（ｐｉｃｌｏｒａｍ／一般名）、ピクロラムの塩およびエステル（ｐｉｃｌｏｒａｍ－ｓａｌｔｓ　ａｎｄ　ｅｓｔｅｒｓ）、ピコリナフエン（ｐｉｃｏｌｉｎａｆｅｎ／一般名）、ピノキサデン（ｐｉｎｏｘａｄｅｎ／一般名）、ピペロフォス（ｐｉｐｅｒｏｐｈｏｓ／一般名）、プレチラクロール（ｐｒｅｔｉｌａｃｈｌｏｒ／一般名）、プリミスルフロンメチル（ｐｒｉｍｉｓｕｌｆｕｒｏｎ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、プロジアミン（ｐｒｏｄｉａｍｉｎｅ／一般名）、プロフルアゾール（ｐｒｏｆｌｕａｚｏｌ／一般名）、プロフォキシジム（ｐｒｏｆｏｘｙｄｉｍ／一般名）、プロメトン（ｐｒｏｍｅｔｏｎ／一般名）、プロメトリン（ｐｒｏｍｅｔｒｙｎ／一般名）、プロパクロール（ｐｒｏｐａｃｈｌｏｒ／一般名）、プロパニル（ｐｒｏｐａｎｉｌ／一般名）、プロパキザホップ（ｐｒｏｐａｑｕｉｚａｆｏｐ／一般名）、プロパジン（ｐｒｏｐａｚｉｎ／一般名）、プロファム（ｐｒｏｐｈａｍ／一般名）、プロピソクロール（ｐｒｏｐｉｓｏｃｈｌｏｒ／一般名）、プロポキシカルバゾンナトリウム（ｐｒｏｐｏｘｙｃａｒｂａｚｏｎｅ－ｓｏｄｉｕｍ／一般名）、プロピリスルフロン（ｐｒｏｐｙｒｉｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、プロピザミド（ｐｒｏｐｙｚａｍｉｄｅ／一般名）、プルスルホカーブ（ｐｒｏｓｕｌｆｏｃａｒｂ／一般名）、プロスルフロン（ｐｒｏｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、ピラクロニル（ｐｙｒａｃｌｏｎｉｌ／一般名）、ピラフルフェンエチル（ｐｙｒａｆｌｕｆｅｎ－ｅｔｈｙｌ／一般名）、ピラスルホトール（ｐｙｒａｓｕｌｆｏｔｏｌｅ／一般名）、ピラゾリネート（ｐｙｒａｚｏｌｙｎａｔｅ／一般名）、ピラゾスルフロン（ｐｙｒａｚｏｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、ピラゾスルフロンエチル（ｐｙｒａｚｏｓｕｌｆｕｒｏｎ－ｅｔｈｙｌ／一般名）、ピラゾキシフェン（ｐｙｒａｚｏｘｙｆｅｎ／一般名）、ピリベンゾキシム（ｐｙｒｉｂｅｎｚｏｘｉｍ／一般名）、ピリブチカルブ（ｐｙｒｉｂｕｔｉｃａｒｂ／一般名）、ピリダフォル（

ｐｙｒｉｄａｆｏｌ／一般名）、ピリデート（ｐｙｒｉｄａｔｅ／一般名）、ピリフタリド（ｐｙｒｉｆｔａｌｉｄ／一般名）、ピリミノバックメチル（ｐｙｒｉｍｉｎｏｂａｃ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、ピリミスルファン（ｐｙｒｉｍｉｓｕｌｆａｎ／一般名）、ピリチオバックナトリウム（ｐｙｒｉｔｈｉｏｂａｃ－ｓｏｄｉｕｍ／一般名）、ピロキサスルホン（ｐｙｒｏｘａｓｕｌｆｏｎｅ／一般名）、ピロキシスラム（ｐｙｒｏｘｓｕｌａｍ／一般名）、キンクロラック（ｑｕｉｎｃｌｏｒａｃ／一般名）、キンメラック（ｑｕｉｎｍｅｒａｃ／一般名）、キノクラミン（ｑｕｉｎｏｃｌａｍｉｎｅ／一般名）、キザロホップ（ｑｕｉｚａｌｏｆｏｐ／一般名）、キザロホップエチル（ｑｕｉｚａｌｏｆｏｐ－ｅｔｈｙｌ／一般名）、キザロホップテフリル（ｑｕｉｚａｌｏｆｏｐ－ｔｅｆｕｒｙｌ／一般名）、Ｐキザロホップ（ｑｕｉｚａｌｏｆｏｐ－Ｐ／一般名）、Ｐキザロホップエチル（ｑｕｉｚａｌｏｆｏｐ－Ｐ－ｅｔｈｙｌ／一般名）、Ｐキザロホップテフリル（ｑｕｉｚａｌｏｆｏｐ－Ｐ－ｔｅｆｕｒｙｌ／一般名）、リムスルフロン（ｒｉｍｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、サフルフェナシル（ｓａｆｌｕｆｅｎａｃｉｌ／一般名）、セトキシジム（ｓｅｔｈｏｘｙｄｉｍ／一般名）、シデュロン（ｓｉｄｕｒｏｎ／一般名）、シマジン（ｓｉｍａｚｉｎｅ／一般名）、シメトリン（ｓｉｍｅｔｒｙｎ／一般名）、ＳＬ－２６１（試験名）、スルコトリオン（ｓｕｌｃｏｔｒｉｏｎｅ／一般名）、スルフェントラゾン（ｓｕｌｆｅｎｔｒａｚｏｎｅ／一般名）、スルフォメツロンメチル（ｓｕｌｆｏｍｅｔｕｒｏｎ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、スルフォスルフロン（ｓｕｌｆｏｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、ＴＣＢＡ（２，３，６－ＴＢＡ／一般名）、ＴＣＢＡの塩およびエステル（２，３，６－ＴＢＡ－ｓａｌｔｓ ａｎｄ ｅｓｔｅｒｓ）、ＴＣＴＰ（ｃｈｌｏｒｔｈａｌ－ｄｉｍｅｔｈｙｌ，ｔｅｔｏｒａｃｈｌｏｒｏｔｈｉｏｐｈｅｎｅ／一般名）、テブタム（ｔｅｂｕｔａｍ／一般名）、テブティウロン（ｔｅｂｕｔｈｉｕｒｏｎ／一般名）、テフリルトリオン（ｔｅｆｕｒｙｌｔｒｉｏｎｅ／一般名）、テンボトリオン（ｔｅｍｂｏｔｒｉｏｎｅ／一般名）、テプラロキシジム（

ｔｅｐｒａｌｏｘｙｄｉｍ／一般名）、ターバシル（ｔｅｒｂａｃｉｌ／一般名）、ターブメトン（ｔｅｒｂｕｍｅｔｏｎ／一般名）、ターブチラジン（ｔｅｒｂｕｔｈｙｌａｚｉｎｅ／一般名）、ターブトリン（ｔｅｒｂｕｔｒｙｎ／一般名）、テトラピオン（ｔｅｔｒａｐｉｏｎ／ｆｌｕｐｒｏｐａｎａｔｅ／一般名）、テニルクロール（ｔｈｅｎｙｌｃｈｌｏｒ／一般名）、チアザフルロン（ｔｈｉａｚａｆｌｕｒｏｎ／一般名）、チアゾピル（ｔｈｉａｚｏｐｙｒ／一般名）、チジアジミン（ｔｈｉｄｉａｚｉｍｉｎ／一般名）、チジアズロン（ｔｈｉｄｉａｚｕｒｏｎ／一般名）、チエンカルバゾンメチル（ｔｈｉｅｎｃａｒｂａｚｏｎｅ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、チフエンスルフロンメチル（ｔｈｉｆｅｎｓｕｌｆｕｒｏｎ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、トルピラレート（ｔｏｌｐｙｒａｌａｔｅ／一般名）、トプラメゾン（ｔｏｐｒａｍｅｚｏｎ／一般名）、トラルコキシジム（ｔｒａｌｋｏｘｙｄｉｍ／一般名）、トリアファモン（ｔｒｉａｆａｍｏｎｅ／一般名）、トリアレート（ｔｒｉａｌｌａｔｅ／一般名）、トリアスルフロン（ｔｒｉａｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、トリアジフラム（ｔｒｉａｚｉｆｌａｍ／一般名）、トリベニュロンメチル（ｔｒｉｂｅｎｕｒｏｎ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、トリクロピル（ｔｒｉｃｌｏｐｙｒ／一般名）、トリクロピルの塩およびエステル（ｔｒｉｃｌｏｐｙｒ－ｓａｌｔｓ　ａｎｄ　ｅｓｔｅｒｓ）、トリディファン（ｔｒｉｄｉｐｈａｎｅ／一般名）、トリエタジン（ｔｒｉｅｔａｚｉｎｅ／一般名）、トリフルディモキサジン（ｔｒｉｆｌｕｄｉｍｏｘａｄｉｎ／一般名）、トリフロキシスルフロン（ｔｒｉｆｌｏｘｙｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、トリフルラリン（ｔｒｉｆｌｕｒａｌｉｎ／一般名）、トリフルスルフロンメチル（ｔｒｉｆｌｕｓｕｌｆｕｒｏｎ－ｍｅｔｈｙｌ／一般名）、トリトスルフロン（ｔｒｉｔｏｓｕｌｆｕｒｏｎ／一般名）、２，４－ＰＡ（一般名）、２，４－ＰＡの塩およびエステル（２，４－ＰＡ－ｓａｌｔｓ　ａｎｄ　ｅｓｔｅｒｓ）、２，４－ＤＢ（一般名）、２，４－ＤＢの塩およびエステル（２，４－ＤＢ－ｓａｌｔｓ　ａｎｄ　ｅｓｔｅｒｓ）等が挙げられる。これらの成分は単独でまたは２種以

上混合して使用することができ、混合する場合の比も自由に選択できる。

[0201] 薬害軽減剤としては、例えば、ＡＤ－６７、ベノキサコル（ｂｅｎｏｘａｃｏｒ／一般名）、クロキントセットメキシル（ｃｌｏｑｕｉｎｔｏｃｅｔ－ｍｅｘｙｌ／一般名）、シオメトリニル（ｃｙｏｍｅｒｉｎｉｌ／一般名）、ジクロルミド（ｄｉｃｈｌｏｒｍｉｄ／一般名）、ジシクロノン（ｄｉｃｙｃｌｏｎｏｎｅ／一般名）、シプロスルファミド（ｃｙｐｒｏｓｕｌｆａｍｉｄｅ／一般名）、ジエトレート（ｄｉｅｔｈｏｒａｔｅ／一般名）、ＤＫＡ－２４、ダイムロン（ｄｙｍｒｏｎ／一般名）、フェンクロラゾールエチル（ｆｅｎｃｌｏｒａｚｏｌｅ－ｅｔｈｙｌ／一般名）、フェンクロリム（ｆｅｎｃｌｏｒｉｍ／一般名）、ヘキシム（ＨＥＸＩＭ／一般名）、フルラゾール（ｆｌｕｒａｚｏｌｅ／一般名）、フルキソフェニム（ｆｌｕｘｏｆｅｎｉｍ／一般名）、フリラゾール（ｆｕｒｉｌａｚｏｌｅ／一般名）、イソキサジフェン（ｉｓｏｘａｄｉｆｅｎ／一般名）、イソキサジフェンエチル（ｉｓｏｘａｄｉｆｅｎ－ｅｔｈｙｌ／一般名）、ＭＣＰＡ、メコプロップ（ｍｅｃｏｐｒｏｐ／一般名）、メフェンピル（ｍｅｆｅｎｐｙｒ／一般名）、メフェンピルエチル（ｍｅｆｅｎｐｙｒ－ｅｔｈｙｌ／一般名）、メフェンピルジエチル（ｍｅｆｅｎｐｙｒ－ｄｉｅｔｈｙｌ／一般名）、メフェネート（ｍｅｐｈｅｎａｔｅ／一般名）、ＭＧ－１９１、ＮＡ（Ｎａｐｈｔｈａｌｉｃ ａｎｈｙｄｒｉｄｅ）、ＯＭ（Ｏｃｔａｍｅｔｈｙｌｅｎｅ－ｄｉａｍｉｎｅ）、オキサベトリニル（ｏｘａｂｅｔｒｉｎｉｌ／一般名）、ＰＰＧ－１２９２、Ｒ－２９１４８等が挙げられる。

これらの農薬活性成分は単独で又は２種以上混合して使用することができ、混合する場合の比も自由に選択できる。

[0202] 本発明化合物の施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、栽培作物等により差異はあるが一般には有効成分量としてヘクタール（ｈａ）当たり０．００５から５０ｋｇ程度が適当である。

[0203] 次に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。尚、以下の配合例において「

部」は重量部を意味する。

水和剤

本発明化合物	０．１～８０部
固体担体	５～９８．９部
界面活性剤	１～１０部
その他	０～　５部

その他として、例えば固結防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

[0204] 乳　剤

本発明化合物	０．１～３０部
液体担体	４５～９５部
界面活性剤	４．９～１５部
その他	０～１０部

その他として、例えば展着剤、分解防止剤等が挙げられる。

[0205] フロアブル（ｆｌｏｗａｂｌｅ）剤

本発明化合物	０．１～７０部
液体担体	１５～９８．８９部
界面活性剤	１～１２部
その他	０．０１～３０部

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等が挙げられる。

[0206] ドライフロアブル（ｄｒｙ　ｆｌｏｗａｂｌｅ）剤

本発明化合物	０．１～９０部
固体担体	０～９８．９部
界面活性剤	１～２０部
その他	０～１０部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

[0207] 液　剤

本発明化合物	０．０１～７０部
液体担体	２０～９９．９９部

その他　　０～１０部

その他として、例えば凍結防止剤、展着剤等が挙げられる。

[0208] 粒　剤

本発明化合物　　０．０１～８０部

固体担体　　１０～９９．９９部

その他　　０～１０部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

[0209] 粉　剤

本発明化合物　　０．０１～３０部

固体担体　　６５～９９．９９部

その他　　０～１０部

その他として、例えばドリフト防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

使用に際しては上記製剤をそのままで、又は水で１～１００００倍に希釈して散布する。

[0210] 製剤例

次に具体的に本発明化合物を有効成分とする農薬製剤例を示すがこれらのみに限定されるものではない。尚、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

〔配合例１〕水和剤

本発明化合物Ｎｏ．１－００１　　２０部

パイロフィライト　　７６部

ソルポール５０３９　　２部

（アニオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名）

カープレックス＃８０　　２部

（合成含水珪酸：塩野義製薬（株）商品名）

以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

[0211] 〔配合例２〕乳　剤

本発明化合物Ｎｏ．１－００１　　５部

キシレン　７５部

Ｎ－メチルピロリドン　１５部

ソルポール２６８０　５部

（アニオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名）

以上を均一に混合して乳剤とする。

[0212] 〔配合例３〕フロアブル剤

本発明化合物Ｎｏ．１－００１　２５部

アグリゾールＳ－７１０　１０部

（非イオン性界面活性剤：花王（株）商品名）

ルノックス１０００Ｃ　０．５部

（アニオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名）

キサンタンガム　０．０２部

水　６４．４８部

以上を均一に混合した後、湿式粉砕してフロアブル剤とする。

[0213] 〔配合例４〕ドライフロアブル剤

本発明化合物Ｎｏ．１－００１　７５部

ハイテノールＮＥ－１５　５部

（アニオン性界面活性剤：第一工業製薬（株式）商品名）

バニレックスＮ　１０部

（アニオン性界面活性剤：日本製紙（株）商品名）

カープレックス＃８０　１０部

（合成含水珪酸：塩野義製薬（株）商品名）

以上を均一に混合粉砕した後、少量の水を加えて撹拌混合捏和し、押出式造粒機で造粒し、乾燥してドライフロアブル剤とする。

[0214] 〔配合例５〕粒　剤

本発明化合物Ｎｏ．１－００１　１部

ベントナイト　５５部

タルク　４４部

以上を均一に混合粉砕した後、少量の水を加えて撹拌混合捏和し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。

実施例

[0215] 以下に本発明において、式（１）で表される複素環アミド化合物の合成例、試験例を実施例として具体的に述べることで、本発明を更に詳しく説明するが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

[0216] 合成例及び参考例に記載した中圧分取液体クロマトグラフィーは、山善株式会社中圧分取装置；ＹＦＬＣ－Ｗｐｒｅｐ（流速１８ｍｌ／ｍｉｎ、シリカゲル４０μｍのカラム）を使用した。

また、実施例のプロトン核磁気共鳴ケミカルシフト値は、基準物質としてMe_4Si（テトラメチルシラン）を用い、３００ＭＨｚにて測定した。また測定に使用した溶媒を以下の合成例中に記載する。また 、実施例のプロトン核磁気共鳴ケミカルシフト値における記号は、下記の意味を表す。

ｓ：シングレット、ｄ：ダブレット、ｔ：トリプレット、ｍ：マルチプレット、ｑ：カルテット、ｂｒ：ブロード

[0217] 合成例

〔合成例１〕

３－イソプロピル－５－メチル－Ｎ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミド（化合物Ｎｏ．１－００３）

工程１；２－ヒドラジニル－６－メチルニコチン酸メチルの合成

２－クロロ－６－メチルニコチン酸メチル３．０ｇ（１６．２ｍｍｏｌ）及びジオキサン３０ｍｌの混合溶液に、室温にてヒドラジン・一水和物１．６２ｇ（３２．３ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応混合物を６０℃にて４時間、続いて８０℃にて６時間撹拌した。撹拌終了後、水を添加し反応を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて抽出（１５０ｍｌ×２回）した。得られた有機層を飽和重曹水で洗浄した後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体

をヘキサンで洗浄し、濾取することにより目的物１．６０ｇを橙色固体として得た。

融点：９０～９１℃

[0218] 工程２：２－（２－イソブチリルヒドラジニル）－６－メチルニコチン酸メチルの合成

２－ヒドラジニル－６－メチルニコチン酸メチル１．５ｇ（８．２８ｍｍｏｌ）、トリエチルアミン８３８ｍｇ（８．２８ｍｍｏｌ）及びテトラヒドロフラン２０ｍｌの混合溶液に、氷冷下にてイソブチリルクロリド８８２ｍｇ（８．２８ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応混合物を氷冷下にて３０分間撹拌した。撹拌終了後、水を添加し反応を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて抽出（１００ｍｌ×１回）した。得られた有機層を水洗後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をヘキサン及びジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物１．６８ｇを肌色固体として得た。

融点：９９～１０１℃

[0219] 工程３：３－イソプロピル－５－メチル－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチルの合成

２－（２－イソブチリルヒドラジニル）－６－メチルニコチン酸メチル１．６ｇ（６３．７ｍｍｏｌ）及びトルエン１０ｍｌの混合溶液に、室温にて塩化ホスホリル３ｍｌを添加した。添加終了後、該反応混合物を加熱還流下にて５時間撹拌した。撹拌終了後、該反応混合物を氷水に添加し反応を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて洗浄（５０ｍｌ×１回）した。得られた水層に氷冷下にて炭酸カリウムを添加しｐＨを８～９とし、該反応液を酢酸エチルにて抽出（１００ｍｌ×２回）した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物４９０ｍｇを淡黄色固体として得た。

融点：１３８～１４０℃

[0220] 工程４：３－イソプロピル－５－メチル－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸の合成

３－イソプロピル－５－メチル－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル４５０ｍｇ（１．９３ｍｍｏｌ）及びメタノール４ｍｌの混合溶液に、室温にて１Ｍ水酸化ナトリウム水溶液２ｍｌを添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて２時間撹拌した。撹拌終了後、１Ｍ塩酸を添加し、ｐＨを２～３とした。該反応液中の溶媒を減圧下にて留去した後、析出した固体を水洗し、濾取することにより、目的物２５０ｍｇを淡黄色固体として得た。

融点：１９４～１９５℃

[0221] 工程５：３－イソプロピル－５－メチル－Ｎ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミドの合成

３－イソプロピル－５－メチル－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸４００ｍｇ（１．９５ｍｍｏｌ）、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド０．１ｍｌ及び塩化メチレン３ｍｌの混合溶媒に、塩化オキサリル４６３ｍｇ（３．９１ｍｍｏｌ）を室温にて添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて１時間撹拌した。撹拌終了後、該反応混合物中の溶媒を減圧下にて留去し、粗３－イソプロピル－５－メチル－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸クロリド・塩酸塩を得た。得られた粗３－イソプロピル－５－メチル－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸クロリド・塩酸塩５４０ｍｇ（１．９５ｍｍｏｌ）、５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－アミン１８０ｍｇ（１．８２ｍｍｏｌ）及び塩化メチレン５ｍｌの混合溶液に、氷冷下にてトリエチルアミン３６８ｍｇ（３．９１ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて２０時間撹拌した。撹拌終了後、該反応混合物にピリジン５ｍｌ及び４－（ジメチルアミノ）ピリジン１０ｍｇを添加した後、該反応混合物を６０℃にて１０時間撹拌した。撹拌終了後

、水を添加し反応を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて抽出（２０ｍｌ×１回）した。得られた有機層を水洗後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムで脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテル及び酢酸エチルで洗浄し、濾取することにより目的物６０ｍｇを茶褐色固体として得た。

[0222] 〔合成例２〕

３－イソプロピル－Ｎ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミド（化合物Ｎｏ．１－００４）

３－イソプロピル－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸１６０ｍｇ（０．５９ｍｍｏｌ）、５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－アミン７０ｍｇ（０．７１ｍｍｏｌ）及びＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド５ｍｌの混合溶液に、室温にて１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩１３５ｍｇ（０．７１ｍｍｏｌ）及び１－ヒドロキシ－７－アザベンゾトリアゾール９６ｍｇ（０．７１ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて２４時間撹拌した。撹拌終了後、水を添加し反応を停止させ、該反応液をクロロホルムにて抽出（１０ｍｌ×１回）した。得られた有機層を水洗後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー｛ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝１：１～０：１（体積比、以下同じである）｝にて精製し、目的物９０ｍｇを白色固体として得た。

融点：１７６～１７８℃

[0223] 〔合成例３〕

３－イソプロピル－Ｎ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－５－（メチルチオ）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミド（化合物Ｎｏ．１－００９）

工程１；２－ヒドラジニル－６－クロロニコチン酸メチルの合成

２、６－ジクロロニコチン酸メチル１１．５ｇ（５５．８ｍｍｏｌ）及びジオキサン１５０ｍｌの混合溶液に、室温にてヒドラジン・一水和物５．５８ｇ（１１１ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて１８時間撹拌した。撹拌終了後、水を添加し反応を停止させ、該反応液中の溶媒を減圧下にて留去した。析出した固体を水洗し、濾取することにより目的物１０．７ｇを黄色固体として得た。

融点：８２～８３℃

[0224] 工程２；２－（２－イソブチリルヒドラジニル）－６－クロロニコチン酸メチルの合成

２－ヒドラジニル－６－クロロニコチン酸メチル５．０ｇ（２４．８ｍｍｏｌ）、トリエチルアミン２．５ｇ（２４．８ｍｍｏｌ）及びテトラヒドロフラン２０ｍｌの混合溶液に、氷冷下にてイソブチリルクロリド２．６４ｇ（２４．８ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応混合物を氷冷下にて２時間撹拌した。撹拌終了後、水を添加し反応を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて抽出（１５０ｍｌ×１回）した。得られた有機層を水洗後、飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテル及びヘキサンで洗浄し、濾取することにより目的物５．９０ｇを白色固体として得た。

融点：１４７～１４８℃

[0225] 工程３；３－イソプロピル－５－クロロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチルの合成

２－（２－イソブチリルヒドラジニル）－６－クロロニコチン酸メチル５．９ｇ（２１．７ｍｍｏｌ）及び塩化ホスホリル２０ｍｌを室温にて混合した後、該反応混合物を加熱還流下にて５時間撹拌した。撹拌終了後、該反応混合物を氷水に添加し反応を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて洗浄（５０ｍｌ×１回）した。得られた水層に氷冷下にて炭酸カリウムを添加しｐＨを８～９とし、該反応液を酢酸エチルにて抽出（２００ｍｌ×２回）した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した

。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物４．７５ｇを茶色淡黄色固体として得た。

融点：１０５～１０７℃

[0226] 工程４：３－イソプロピル－５－（メチルチオ）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチルの合成

３－イソプロピル－５－クロロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル４２０ｍｇ（１．６６ｍｍｏｌ）及びＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド３ｍｌの混合溶液に、氷冷下にてナトリウムチオメトキシド１４０ｍｇ（１．９９ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応混合物を氷冷下にて４５分間撹拌した。撹拌終了後、水を添加し反応を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて抽出（３０ｍｌ×３回）した。得られた有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物２８０ｍｇを茶色固体として得た。

融点：１４２～１４５℃

[0227] 工程５：３－イソプロピル－Ｎ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－５－（メチルチオ）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミドの合成

３－イソプロピル－５－（メチルチオ）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル１４０ｍｇ（０．５３ｍｍｏｌ）、メタノール３ｍｌ及び水１ｍｌの混合溶液に、１Ｍ水酸化ナトリウム水溶液０．６ｍｌを室温下にて添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて１７時間撹拌した。撹拌終了後、１Ｍ塩酸１ｍｌを添加して反応を停止させた。該反応液中の溶媒を減圧下にて留去し、粗３－イソプロピル－５－（メチルチオ）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸を得た。得られた粗３－イソプロピル－５－（メチルチオ）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸１９０ｍｇ（０．５３ｍｍｏｌ）、５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－

アミン１０４ｍｇ（１．０６ｍｍｏｌ）及びピリジン３ｍｌの混合溶液に、室温にて塩化チオニル１２６ｍｇ（１．０６ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応混合物を６０℃にて５時間撹拌した。撹拌終了後、水を添加し反応を停止させ、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテル及びクロロホルムで洗浄し、濾取することにより目的物５７ｍｇを黄土色固体として得た。

[0228] 〔合成例４〕

３－クロロ－Ｎ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミド（化合物Ｎｏ．１－０１３）

工程１；３－クロロ－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸の合成

５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸３００ｍｇ（１．３０ｍｍｏｌ）及びＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド６ｍｌの混合溶液に、Ｎ－クロロスクシンイミド３４７ｍｇ（２．６０ｍｍｏｌ）を室温にて添加した。添加終了後、該反応混合物を６０℃にて４時間撹拌した。撹拌終了後、水を添加し反応を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて抽出（５０ｍｌ×２回）した。得られた有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物２１０ｍｇを茶色固体として得た。

[0229] 工程２；３－クロロ－Ｎ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミドの合成

３－クロロ－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸７０ｍｇ（０．２６ｍｍｏｌ）、５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－アミン５２ｍｇ（０．５３ｍｍｏｌ）、４－（ジメチルアミノ）ピリジン１０ｍｇ（０．０３ｍｍｏｌ

）及びピリジン５ｍｌの混合溶液に、塩化チオニル６３ｍｇ（０．５３ｍｍｏｌ）を室温にて添加した。該反応混合物を室温にて１時間撹拌した。撹拌終了後、水を添加し反応を停止させ、該反応液をクロロホルムにて抽出（１５ｍｌ×３回）した。得られた有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物５２ｍｇを淡黄色固体として得た。

融点：２３８～２４１℃

[0230] 〔合成例５〕

３－イソプロピル－Ｎ－（４－メチル－１，２，５－オキサジアゾール－３－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミド（化合物Ｎｏ．３－００１）

３－イソプロピル－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸１６５ｍｇ（０．６０ｍｍｏｌ）、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド０．１ｍｌ及び塩化メチレン５ｍｌの混合溶液に、室温にて塩化オキサリル８３ｍｇ（０．６６ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて２０分間撹拌した。撹拌終了後、４－メチル－１，２，５－オキサジアゾール－３－アミン１１９ｍｇ（１．２１ｍｍｏｌ）、トリエチルアミン１２２ｍｇ（１．２１ｍｍｏｌ）及び塩化メチレン３ｍｌの混合溶液を添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて１時間撹拌した。撹拌終了後、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝９：１～２：１）にて精製し、目的物１６８ｍｇを白色固体として得た。

融点：１８５～１８６℃

[0231] 〔合成例６〕

５－クロロ－３－イソプロピル－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－イル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミド（化合物Ｎｏ．２－００４）

５－クロロ－３－イソプロピル－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル５００ｍｇ（１．９７ｍｍｏｌ）、メタノール３ｍｌ及び水１ｍｌの混合溶液に、氷冷下にて１Ｍ水酸化ナトリウム水溶液２ｍｌを添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて１時間撹拌した。撹拌終了後、１Ｍ塩酸２．５ｍｌを添加して反応を停止させた。該反応液中の溶媒を減圧下にて留去し、粗５－クロロ－３－イソプロピル－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸を得た。得られた粗５－クロロ－３－イソプロピル－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸５００ｍｇ（１．９７ｍｍｏｌ）、１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－アミン３９０ｍｇ（３．９４ｍｍｏｌ）、４－（ジメチルアミノ）ピリジン２４ｍｇ（０．１９ｍｍｏｌ）及びピリジン５ｍｌの混合溶液に、室温にて塩化チオニル４６９ｍｇ（３．９４ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて２日間撹拌した。撹拌終了後、水を添加し反応を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて抽出（５０ｍｌ×２回）した。得られた有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（ｎ－ヘキサン：酢酸エチル＝４：１～１：１）にて精製し、目的物１４０ｍｇを淡黄色固体として得た。

融点：１８９～１９０℃

[0232] ［合成例７］

３－（メトキシメチル）－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミド（化合物Ｎｏ．２－０１０）

工程１；２－（２－（２－メトキシアセチル)ヒドラジニル）－６－（トリフルオロメチル）ニコチン酸メチルの合成（化合物Ｎｏ．Ａ１－０５ａ）

２－ヒドラジニル－６－（トリフルオロメチル）ニコチン酸メチル１．０ｇ（４．２５ｍｍｏｌ）、トリエチルアミン４７３ｍｇ（４．６８ｍｍｏｌ）及びテトラヒドロフラン２０ｍｌの混合溶液に、氷冷下にてメトキシアセ

チルクロリド５０８ｍｇ（４．６８ｍｍｏｌ）のテトラヒドロフラン２ｍｌ溶液を添加した。添加終了後、該反応溶液を氷冷下にて３０分間撹拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去し、水１５ｍｌを添加した後、クロロホルムにて抽出（３０ｍｌ×１回、１０ｍｌ×２回）した。得られた有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物１．１６ｇを白色固体として得た。

融点：７６～７７℃

[0233] 工程２；３－（メトキシメチル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチルの合成（化合物Ｎｏ．Ｂ１－０５ａ）

２－（２－（２－メトキシアセチル)ヒドラジニル）－６－（トリフルオロメチル）ニコチン酸メチル１．１６ｇ（３．７８ｍｍｏｌ）及びトルエン１７ｍｌの混合溶液に、室温にて塩化ホスホリル１．７４ｇ（１１．３ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応溶液を加熱還流下にて５時間撹拌した。反応終了後、該反応溶液を別途用意した水２０ｍｌに注ぎ、炭酸水素ナトリウム水溶液を加えてｐＨを８～９とした後、酢酸エチルにて抽出（３０ｍｌ×１回、１５ｍｌ×３回）した。合わせた有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物７２１ｍｇを黄色固体として得た。

融点：９５～９７℃

[0234] 工程３；３－（メトキシメチル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸の合成（化合物Ｎｏ．Ｃ１－０５）

３－（メトキシメチル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル６９３ｍｇ（２．３９ｍｍｏｌ）及びエタノール７ｍｌの混合溶液に、氷冷下にて水酸化ナ

トリウム１１５ｍｇ（２．８７ｍｍｏｌ）の水溶液７ｍｌを添加した。添加終了後、該反応溶液を氷冷下にて３０分間撹拌した。反応終了後、該反応溶液に１Ｍ塩酸を添加し、ｐＨを２～３とした後、クロロホルムにて抽出（３０ｍｌ×１回、１５ｍｌ×３回）した。得られた有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物５５３ｍｇを黄色固体として得た。

融点：１１１～１１２℃

[0235] 工程４：３－（メトキシメチル）－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミドの合成

３－（メトキシメチル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸１００ｍｇ（０．３６ｍｍｏｌ）、１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－アミン７２ｍｇ（０．７３ｍｍｏｌ）、４－ジメチルアミノピリジン５ｍｇ及びピリジン２ｍｌの混合溶液に、塩化チオニル８７ｍｇ（０．７３ｍｍｏｌ）を室温にて添加した。添加終了後、該反応溶液を室温にて３０分間撹拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した。得られた残渣に１ｍｏｌ／Ｌ塩酸を添加し、ｐＨを２～３とした後、クロロホルムにて抽出（１５ｍｌ×３回）した。得られた有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物７６ｍｇを白色固体として得た。

融点：２０５～２０９℃

[0236] 〔合成例８〕

Ｎ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－３－（メチルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミド（化合物Ｎｏ．１－０１８）

工程１；３－チオキソ－５－（トリフルオロメチル）－２，３－ジヒドロ

－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチルの合成

２－ヒドラジニル－６－（トリフルオロメチル）ニコチン酸メチル１．０ｇ（４．２５ｍｍｏｌ）、１，１′－チオカルボニルジイミダゾール７９５ｍｇ（４．４６ｍｍｏｌ）及びＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド１０ｍｌの混合溶液を、６０℃にて３時間撹拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物とイミダゾールの混合物５３４ｍｇを赤色固体として得た。

[0237] 工程２；３－（メチルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチルの合成

工程１で得られたイミダゾールを含む３－チオキソ－５－（トリフルオロメチル）－２，３－ジヒドロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル５３４ｍｇのＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド１０ｍｌ溶液に、ヨウ化メチル４０２ｍｇを室温にて添加した。添加終了後、該反応溶液を室温にて１．５時間撹拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した。得られた残渣に水１５ｍｌを添加し、クロロホルムにて抽出（１５ｍｌ×３回）した。得られた有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物３３６ｍｇを黄色固体として得た。

融点：１６３～１６７℃

[0238] 工程３；３－（メチルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸の合成

３－（メチルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル３３２ｍｇ（１．１４ｍｍｏｌ）及びメタノール３ｍｌの混合溶液に、氷冷下にて０．５ｍｏｌ／Ｌの水酸化ナトリウム水溶液２．８ｍｌ（１．４ｍｍｏｌ）を添加した。

添加終了後、該反応溶液を氷冷下にて１時間撹拌した。反応終了後、該反応溶液に１ｍｏｌ／Ｌ塩酸を添加し、ｐＨを２～３とした。析出した固体を濾取し、１ｍｏｌ／Ｌ塩酸、水、ジイソプロピルエーテルで洗浄することにより目的物２２８ｍｇを黄色固体として得た。

融点：１５８～１６２℃

[0239] 工程４：Ｎ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－３－（メチルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミドの合成

３－（メチルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸１００ｍｇ（０．３６ｍｍｏｌ）、５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－アミン７１ｍｇ（０．７２ｍｍｏｌ）、４－ジメチルアミノピリジン４ｍｇ及びピリジン２ｍｌの混合溶液に、塩化チオニル１２９ｍｇ（１．０８ｍｍｏｌ）を氷冷下にて添加した。添加終了後、該反応溶液を室温にて２０分間撹拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した。得られた残渣に１ｍｏｌ／Ｌ塩酸を添加し、ｐＨを２～３とし、クロロホルムにて抽出（１５ｍｌ×３回）した。得られた有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄し、濾取することにより目的物１００ｍｇを黄色固体として得た。

融点：２３０～２３３℃

[0240] ［合成例９］

３－イソプロピル－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボチオアミド（化合物Ｎｏ．２－０３９）

３－イソプロピル－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミド１００ｍｇ（０．２８ｍｍｏｌ）、ローソン

試薬［Ｌａｗｅｓｓｏｎ’ｓ　Ｒｅａｇｅｎｔ：2,4－ビス(4－メトキシフェニル)－1,3,2,4－ジチアジホスフェタン－2,4－ジスルフィド］１１４ｍｇ（０．２８ｍｍｏｌ）及びトルエン３ｍｌの混合溶液を、１１０℃にて５時間撹拌した。撹拌終了後、該反応溶液にローソン試薬１１４ｍｇ（０．２８ｍｍｏｌ）を添加し、１１０℃で３時間撹拌を継続した。反応終了後、該反応溶液に０．１規定塩酸５ｍｌを添加し、酢酸エチル（１５ｍｌ×１）で抽出した。得られた有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣をｎ－ヘキサン－酢酸エチル（４：１～３：７のグラジエント）にて溶出する中圧分取液体クロマトグラフィーにて精製し、目的物６６ｍｇを黄色固体として得た。

融点：１９８～２００℃

[0241]［合成例１０］

３－アリル－Ｎ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［1，2，4］トリアゾロ［4，3－a］ピリジン－８－カルボキサミド及びＮ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－３－（プロプ－１－エン－１－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［1，2，4］トリアゾロ［4，3－a］ピリジン－８－カルボキサミド（化合物Ｎｏ．１－１５９及び化合物Ｎｏ．１－１５９＊）

工程１；３－アリル－５－（トリフルオロメチル）－［1，2，4］トリアゾロ［4，3－a］ピリジン－８－カルボン酸メチル及び３－（プロプ－１－エン－１－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［1，2，4］トリアゾロ［4，3－a］ピリジン－８－カルボン酸メチルの合成

合成例７の工程１と同様の方法で合成した２－（２－（ブチ－３－エノイル)ヒドラジニル）－６－（トリフルオロメチル）ニコチン酸メチル１．２０ｇ（３．９６ｍｍｏｌ）及びトルエン１８ｍｌの混合溶液に、室温にて塩化ホスホリル１．８２ｇ（１１．９ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応溶液を加熱還流下にて１．５時間撹拌した。反応終了後、該反応溶液を別

途用意した水２０ｍｌに注ぎ、炭酸水素ナトリウム水溶液を加えてｐＨを８～９とした後、酢酸エチルにて抽出（３０ｍｌ×１回、１５ｍｌ×３回）した。合わせた有機層を飽和食塩水、次いで無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣をｎ－ヘキサン－酢酸エチル（７：３～０：１のグラジエント）にて溶出する中圧分取液体クロマトグラフィーにて精製し、目的物７３０ｍｇを白色固体として得た［３－アリル－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル／３－（プロプ－１－エン－１－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル＝４／１］。

３－アリル－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチルの^{1}H NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ7.97 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.44 (d, 1H, J=7.2Hz), 6.31-6.20 (m, 1H), 5.26-5.12 (m, 2H), 4.10 (s, 3H), 4.00 (dd, 2H, J=6.3Hz, 1.2Hz)。

３－（プロプ－１－エン－１－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチルの^{1}H NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ7.94 (d, 1H, J=6.0Hz), 7.42 (d, 1H, J=6.0Hz), 7.00-6.90 (m, 1H), 6.66-6.58 (m, 1H), 4.10 (s, 3H), 2.04 (dd, 3H, J=6.6Hz, 1.8Hz)。

融点：１２１～１２３℃

[0242] 工程２；３－アリル－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸及び３－（プロプ－１－エン－１－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸の合成

３－アリル－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル及び３－（プロプ－１－エン－１－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチルの混合物７２０ｍｇ（２．６

５ｍｍｏｌ）及びエタノール１０ｍｌの混合溶液に、氷冷下にて０．５ｍｏｌ／Ｌの水酸化ナトリウム水溶液７．０ｍｌ（３．５ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応溶液を氷冷下にて３０分間撹拌した。反応終了後、該反応溶液に１Ｍ塩酸を添加し、ｐＨを２～３とした後、酢酸エチルにて抽出（１５ｍｌ×２回）した。得られた有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去し、目的物４６７ｍｇを白色固体として得た［３－アリル－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸／３－（プロプ－１－エン－１－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸＝４／１］。

３－アリル－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸の^{1}H NMR（$CDCl_3$，Me_4Si，300MHz）δ8.25 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.61 (d, 1H, 7.5Hz), 6.34-6.20 (m, 1H), 5.35-5.22 (m, 2H), 4.00 (dd, 2H, J=6.3Hz, 1.2Hz)。（CO_2Hのプロトンピークは観測されなかった。）

３－（プロプ－１－エン－１－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸の^{1}H NMR（$CDCl_3$，Me_4Si，300MHz）δ8.22 (d, 1H, J=8.1Hz), 7.58 (d, 1H, J=8.1Hz), 7.12-7.00 (m, 1H), 6.67-6.60 (m, 1H), 2.07 (dd, 3H, J=6.9Hz, 1.8Hz)。（CO_2Hのプロトンピークは観測されなかった。）

融点：１０３～１０４℃

[0243] 工程３；３－アリル－Ｎ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミド及びＮ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－３－（プロプ－１－エン－１－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミドの合成

３－アリル－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［

４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸及び３－（プロプ－１－エン－１－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸の混合物１００ｍｇ（０．３７ｍｍｏｌ）、５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－アミン５５ｍｇ（０．５５ｍｍｏｌ）、１－ヒドロキシ－７－アザベンゾトリアゾール５ｍｇ（０．０４ｍｍｏｌ）及びＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド２ｍｌの混合溶液に、室温にて１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩１０６ｍｇ（０．５５ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応混合物を室温にて１時間撹拌した。撹拌終了後、１ｍｏｌ／ｌ塩酸３ｍｌを添加し、該反応液を酢酸エチルにて抽出（１０ｍｌ×２回）した。得られた有機層を水洗後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた固体を酢酸エチルからの再結晶にて精製し、目的物６７ｍｇを淡黄色固体として得た［３－アリル－Ｎ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミド／Ｎ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－３－（プロプ－１－エン－１－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミド＝４／１］。

３－アリル－Ｎ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミドの^{1}H NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ12.9 (brs, 1H), 8.42 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.63 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.38-6.24 (m, 1H), 5.36-5.23 (m, 2H), 4.03 (dd, 2H, J=6.9Hz, 1.2Hz), 2.59 (s, 3H)。

Ｎ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－３－（プロプ－１－エン－１－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミドの^{1}H NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ12.9 (brs, 1H), 8.38 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.60 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.12-7.00 (m, 1H), 6.69-6.62 (m, 1H), 2.60 (s, 3H), 2.09 (d

d，3H，J=6.6Hz，1.8Hz)。

融点：１５９～１６１℃

[0244] 〔合成例１１〕

３－アリル－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミド及びＮ－（１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－イル）－３－（プロプ－１－エン－１－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミド（化合物Ｎｏ．２－１０５及び化合物Ｎｏ．２－１０５＊）

合成例７の工程２で合成した３－アリル－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸及び３－（プロプ－１－エン－１－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸の混合物１００ｍｇ（０．３７ｍｍｏｌ）、１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－アミン５６ｍｇ（０．５７ｍｍｏｌ）及びピリジン２ｍｌの混合溶液に、塩化チオニル６６ｍｇ（０．５５ｍｍｏｌ）を１５℃以下の温度にて添加した。添加終了後、該反応溶液を１５℃以下に保ち１．５時間撹拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した。得られた残渣にアセトニトリル１．５ｍｌ及び１ｍｏｌ／Ｌ塩酸２ｍｌを添加し、酢酸エチルにて抽出（１０ｍｌ×２回）した。得られた有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体を酢酸エチルで洗浄し、濾取することにより目的物２７ｍｇをうす茶色固体として得た

［３－アリル－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミド／Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－イル）－３－（プロプ－１－エン－１－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミド＝３／１］。

３－アリル－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミドの^{1}H NMR（$CDCl_3$，Me_4Si，300MHz）δ12.5（brs，1H），8.40（d，1H，J=7.5Hz），7.65（d，1H，J=7.5Hz），6.37-6.24（m，1H），5.37-5.24（m，2H），4.13（s，3H），4.06（dd，2H，J=6.6Hz，1.2Hz）。

Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－イル）－３－（プロプ－１－エン－１－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミドの^{1}H NMR（$CDCl_3$，Me_4Si，300MHz）δ12.5（brs，1H），8.36（d，1H，J=7.2Hz），7.62（d，1H，J=7.2Hz），7.13-7.01（m，1H），6.70-6.62（m，1H），4.13（s，3H），2.10（dd，3H，J=6.6Hz，1.5Hz）。

融点：１６４～１６７℃

[0245] ［合成例１２］

３－（２，２－ジクロロ－１－メチルシクロプロピル）－Ｎ－エチル－Ｎ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミド（化合物Ｎｏ．１－１７４）

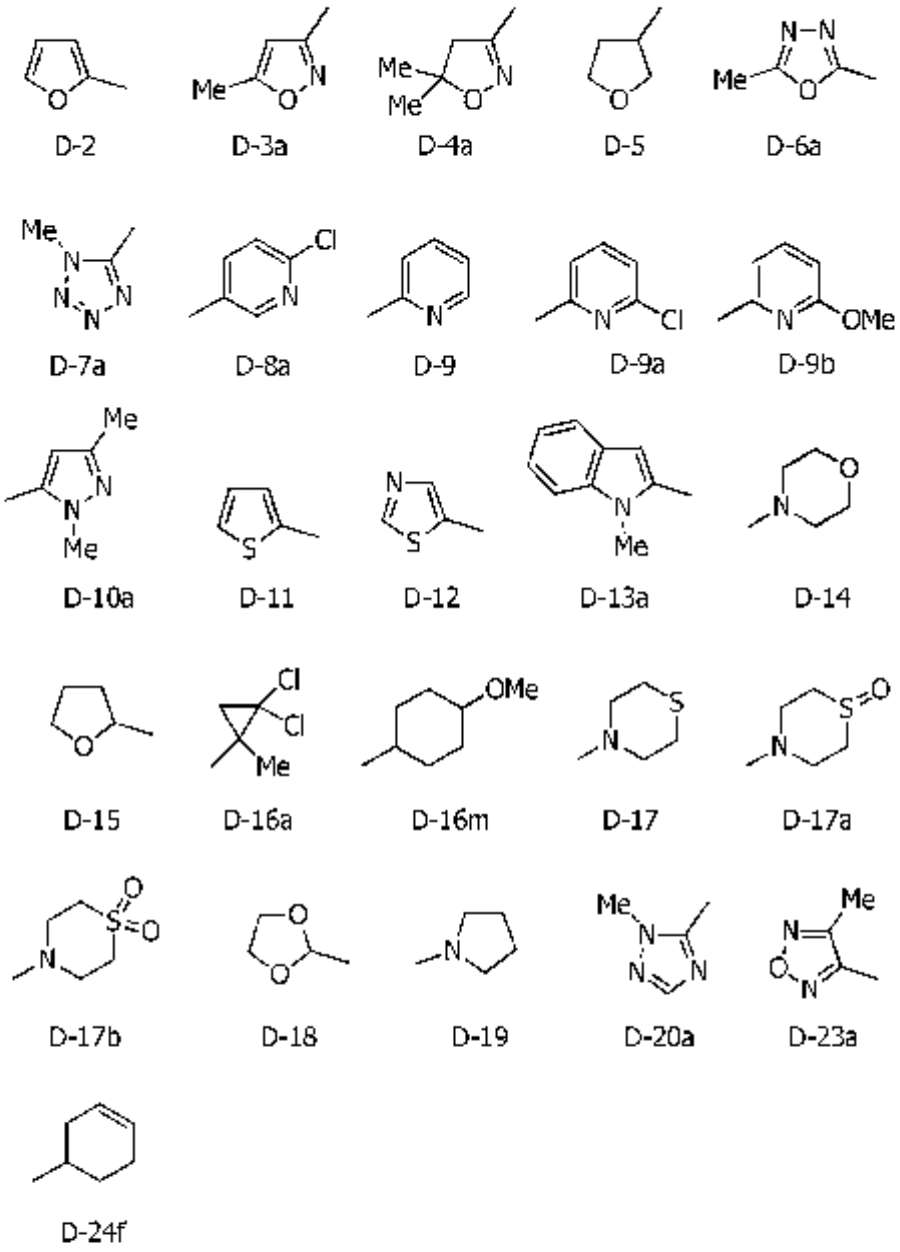
３－（２，２－ジクロロ－１－メチルシクロプロピル）－Ｎ－（５－メチル－１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボキサミド６７ｍｇのＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド１ｍｌ溶液に、炭酸カリウム３１ｍｇ及びヨウ化エチル４８ｍｇを室温にて添加した。添加終了後、該反応混合物を５５℃にて３０分間撹拌した。反応終了後、水２ｍｌを加え、酢酸エチル（３ｍｌ×２）で抽出した。得られた有機層を飽和食塩水、無水硫酸マグネシウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣をｎ－ヘキサン－酢酸エチル（２：１～０：１のグラジエント）にて溶出する中圧分取液体クロマトグラフィーにて精製し、目的物２１ｍｇを無色樹脂状物質として得た。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ7.72 (d, 1H, J=7.8Hz), 7.53 (d, 1H, J=7.8Hz), 4.15 (q, 2H, J=7.2Hz), 2.78 (d, 1H, J=7.8Hz), 2.38 (s, 3H), 1.83 (d, 1H, J=7.8Hz), 1.80 (s, 3H), 1.43 (t, 3H, J=7.2Hz)。

[0246] 本発明化合物は、前記合成例に準じて合成することができる。合成例１乃至合成例９と同様に製造した本発明化合物の例を第４表乃至第１０表に示すが、本発明はこれらのみに限定されるものではない。尚、表中Ｍｅとの記載はメチル基を表し、以下同様にＥｔはエチル基を、Ｐｒはプロピル基を、Ｐｅｎはペンチル基を、Ｈｅｘはヘキシル基を、Ｐｈはフェニル基を、Ｂｎはベンジル基を、ｉ－はイソを、ｃ－はシクロ及びｔ－はターシャリーを各々意味する。

[0247] また、表中Ｄ－２、Ｄ－３ａ、Ｄ－４ａ、Ｄ－５、Ｄ－６ａ、Ｄ－７ａ、Ｄ－８ａ、Ｄ－９、Ｄ－９ａ、Ｄ－９ｂ、Ｄ－１０ａ、Ｄ－１１、Ｄ－１２、Ｄ－１３ａ、Ｄ－１４、Ｄ－１５、Ｄ－１６ａ、Ｄ－１６ｍ、Ｄ－１７、Ｄ－１７ａ、Ｄ－１７ｂ、Ｄ－１８、Ｄ－１９、Ｄ－２０ａ、Ｄ－２３ａ、Ｄ－２４ｆで表される置換基は、以下の構造を表す。

[化43]

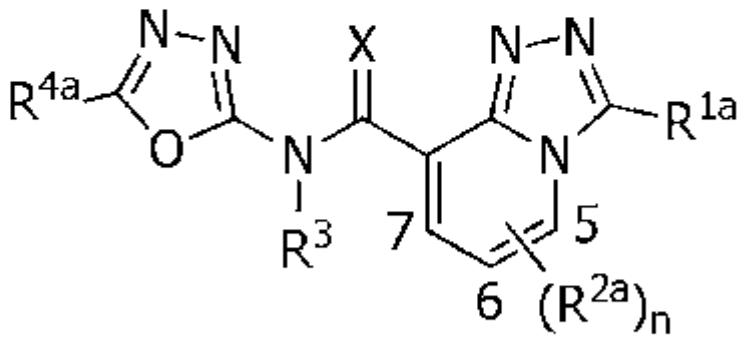


[0248] 尚、表中、「＊１」は「樹脂状」を表す。「＊２」は融点測定時に分解が見られたことを意味する。「＊３」は構造の異なる異性体である本発明化合物１－１５８と１－１５８＊の混合物であり、その割合は１－１５８／１－１５８＊＝９／１である。「＊４」は合成例１０に記載の通り、構造の異なる異性体である本発明化合物１－１５９と１－１５９＊の混合物であり、その割合は１－１５９／１－１５９＊＝４／１である。「＊５」は合成例１１に記載の通り、構造の異なる異性体である本発明化合物２－１０５と２－１

０５＊の混合物であり、その割合は２－１０５／２－１０５＊＝３／１である。

[0249] 〔第４表〕

[化44]



[表27]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^1	R^2	融点(℃)
1-001	H	5-CF_3	O	H	Me	220-223
1-002	Me	5-CH_3	O	H	Me	242-245
1-003	i-Pr	5-Me	O	H	Me	*2
1-004	i-Pr	5-CF_3	O	H	Me	176-178
1-005	i-Pr	5-CF_3	O	H	Et	176-180
1-006	i-Pr	5-CF_3	O	H	Bn	141-150
1-007	i-Pr	5-CH_3	O	H	Ph	173-177
1-008	i-Pr	5-CF_3	O	H	D-2	152-156
1-009	i-Pr	5-SMe	O	H	Me	*2
1-010	c-Pr	5-CF_3	O	H	Me	157-165
1-011	3-Pen	5-CF_3	O	H	Me	171-174
1-012	Ph	5-CF_3	O	H	Me	266-270
1-013	Cl	5-CH_3	O	H	Me	238-241
1-014	Br	5-CF_3	O	H	Me	252-260
1-015	CH_2OMe	5-CF_3	O	H	Me	115-125
1-016	4-MeO-Ph	5-CF_3	O	H	Me	205-208
1-017	4-Cl-Ph	5-CF_3	O	H	Me	256-258
1-018	SMe	5-CH_3	O	H	Me	230-233
1-019	$CH_2O(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	90-91
1-020	$CH_2OCH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	148-149
1-021	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	150-162
1-022	D-3a	5-CF_3	O	H	Me	218-221
1-023	i-Pr	6-CF_3	O	H	Me	160-162
1-024	n-Pr	5-CF_3	O	H	Me	172-176
1-025	CH_2OPh	5-CF_3	O	H	Me	188-190
1-026	c-Pen	5-CF_3	O	H	Me	170-171
1-027	CH_2OEt	5-CF_3	O	H	Me	141-143
1-028	L-Bu	5-CF_3	O	H	Me	161-165
1-029	D-4a	5-CH_3	O	H	Me	172-176
1-030	CH_2SMe	5-CF_3	O	H	Me	153-155
1-031	$CH_2SCH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	152-163
1-032	SEt	6-CF_3	O	H	Me	182-184
1-033	$SCH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	186-188
1-034	S(O)Et	6-CF_3	O	H	Me	192-193
1-035	$S(O)CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	153-157
1-036	$CH_2S(O)Me$	5-CF_3	O	H	Me	190-191
1-037	$CH_2S(O)_2Me$	5-CF_3	O	H	Me	*1
1-038	$CH_2S(O)CH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	200-202
1-039	$CH_2S(O)_2CH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	*1
1-040	$S(O)_2Me$	5-CH_3	O	H	Me	*1
1-041	$S(O)_2Et$	5-CF_3	O	H	Me	*1
1-042	$CH_2C(O)OEt$	5-CF_3	O	H	Me	187-189
1-043	4-Me-Ph	5-CF_3	O	H	Me	221-223
1-044	4-F-Ph	5-CF_3	O	H	Me	203-208
1-045	4-CF_3-Ph	5-CF_3	O	H	Me	196-198
1-046	3-MeO-Ph	5-CF_3	O	H	Me	176-182
1-047	2-MeO-Ph	5-CF_3	O	H	Me	180-185
1-048	$CH_2C(O)OEt$	5-CF_3	O	H	Me	139-141

[表28]

No.	R^{1*}	$(R^{2*})_n$	X	R^3	R^4	融点(℃)
I-049	$CH_2C(O)CCH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	157-159
I-050	i-Pr	5-CF_3	O	H	Et	171-175
I-051	i-Pr	5-CF_3	O	H	c-Pr	161-162
I-052	i-Pr	5-CF_3	O	H	$(CH_2)_2OMe$	125-135
I-053	i-Pr	5-CF_2H	O	H	Me	160-162
I-054	D-8a	5-CF_3	O	H	Me	240-243
I-055	D-9a	5-CF_3	O	H	Me	205-208
I-056	D-10a	5-CF_3	O	H	Me	274-276
I-057	D-11	5-CF_3	O	H	Me	222-224
I-058	D-12	5-CF_3	O	H	Me	213-216
I-059	D-13a	5-CF_3	O	H	Me	272-274
I-060	$CH_2C(O)C(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	152-153
I-061	$CH_2C(O)NHCH(CF_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	222-227
I-062	$CH_2OC(O)Me$	5-CF_3	O	H	Me	165-167
I-063	$S(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	99-101
I-064	$SCH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	215-217
I-065	$SCH_2C\equiv CH$	5-CF_3	O	H	Me	114-117
I-066	i-Pr	5-CF_2CF_3	O	H	Me	193-195
I-067	CH_2OH	5-CF_3	O	H	Me	236-238
I-068	CHO	5-CF_3	O	H	Me	222-223
I-069	CH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	172-174
I-070	3,5-$(MeO)_2$-Ph	5-CF_3	O	H	Me	223-229
I-071	3,5-Cl_2-Ph	5-CF_3	O	H	Me	254-256
I-072	CH=NOMe	5-CF_3	O	H	Me	204-207
I-073	$S(O)(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	199-201
I-074	$S(O)CH_2CH-CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	134-137
I-075	i-Pr	5-CF_3-6-Me	O	H	Me	168-169
I-076	NMe_2	5-CF_3	O	H	Me	184-185
I-077	$S(O)CH_2C\equiv CH$	5-CF_3	O	H	Me	205-212
I-078	CH(Me)SMe	5-CF_3	O	H	Me	137-139
I-079	CH(Me)S(O)Me	5-CF_3	O	H	Me	127-129
I-080	CH(Me)$S(O)_2$Me	5-CF_3	O	H	Me	159-160
I-081	i-Pr	5-Ph	O	H	Me	131-133
I-082	NHPh	5-CF_3	O	H	Me	179-182
I-083	$(CH_2)_2$SMe	5-CF_3	O	H	Me	157-159
I-084	$(CH_2)_2S(O)Me$	5-CF_3	O	H	Me	179-181
I-085	$(CH_2)_2S(O)_2Me$	5-CF_3	O	H	Me	191-192
I-086	N(Me)Ph	5-CF_3	O	H	Me	175-178
I-087	$S(CH_2)_2CH_3$	5-CF_2H	O	H	Me	141-142
I-088	i-Pr	5-(3,5-$(F)_2$-Ph)	O	H	Me	191-193
I-089	i-Pr	5-CF_3-7-Me	O	H	Me	120-124
I-090	$NHCF(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	163-164
I-091	$SCH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	H	211-213
I-092	$S(O)(CH_2)_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	193-195
I-093	$SCH_2CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	143-145
I-094	$SCH(CH_3)CH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	150-153
I-095	$SC(CH_3)_3$	5-CF_3	O	H	Me	178-180
I-096	D-14	5-CF_3	O	H	Me	166-168

[表29]

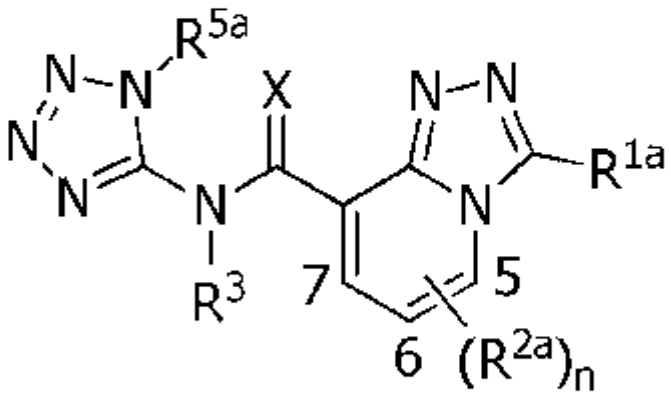
No.	R^{1A}	$(R^{2A})_n$	X	R^3	R^{4C}	融点(℃)
1-097	i-Pr	5-CF_3	O	H	D-15	108-111
1-098	i-Pr	5-CF_3	O	H	D-14	*1
1-099	i-Pr	5-CF_3	O	H	4-MeO-Ph	154-158
1-100	i-Pr	5-CF_3	O	H	CF_3	111-116
1-101	i-Pr	5-CF_3	O	H	D-9	167-169
1-102	NH(D-9b)	5-CF_3	O	H	Me	219-221
1-103	NMe_2	5-CF_3	O	H	H	200-205
1-104	CH_2(c-Pr)	5-CF_3	O	H	Me	160-163
1-105	D-16a	5-CF_3	O	H	Me	232-235
1-106	SEt	5-CF_3	O	H	H	189-191
1-107	$CH_2O(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	H	117-118
1-108	$S(CH_2)_2CH_3$	5-CF_3	O	H	H	198-200
1-109	$NH(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	150-155
1-110	D-14	5-CF_3	O	H	H	180-182
1-111	$NHS(O)_2Ph$	5-CF_3	O	H	Me	259-261
1-112	OEt	5-CF_3	O	H	H	135-145
1-113	SCH_2Ph	5-CF_3	O	H	Me	187-190
1-114	SCH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	155-158
1-115	SCH_2(c-Pr)	5-CF_3	O	H	Me	135-137
1-116	SCH_2(D-15)	5-CF_3	O	H	Me	142-145
1-117	SCH_2CN	5-CF_3	O	H	Me	179-182
1-118	D-17	5-CF_3	O	H	Me	*1
1-119	D-17a	5-CF_3	O	H	Me	250-255
1-120	D-17b	5-CF_3	O	H	Me	235-238
1-121	N(Me)$(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	H	131-134
1-122	N(Me)$CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	H	155-157
1-123	N(Me)(c-Hex)	5-CF_3	O	H	H	54-66
1-124	SCH_2CF_3	5-CF_3	O	H	Me	156-157
1-125	$SCH_2C(O)CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	178-182
1-126	SCH_2(D-18)	5-CF_3	O	H	Me	200-203
1-127	$SCH_2C(O)CMe$	5-CF_3	O	H	Me	184-185
1-128	$SCH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	H	138-140
1-129	N(Me)$(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	75-80
1-130	$NH(CH_2)_2SMe$	5-CF_3	O	H	Me	111-115
1-131	$NHCF_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	140-144
1-132	N(Me)$CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	164-168
1-133	N(Me)(c-Hex)	5-CF_3	O	H	Me	135-140
1-134	N(Me)Et	5-CF_3	O	H	Me	125-128
1-135	$N(Et)_2$	5-CF_3	O	H	Me	135-137
1-136	D-19	5-CF_3	O	H	Me	151-152
1-137	N(Me)Et	5-CF_3	O	H	H	141-143
1-138	$N(Et)_2$	5-CF_3	O	H	H	130-131
1-139	D-19	5-CF_3	C	F	H	217-218
1-140	i-Pr	5-CF_3	C	F	D-11	200-201
1-141	i-Pr	5-CF_3	C	F	CH_2SMe	114-116
1-142	i-Pr	5-CF_3	C	F	$CH_2S(O)_2Me$	171-173
1-143	i-Pr	5-CF_3	C	F	$CH_2S(O)Me$	149-150
1-144	c-Pr	5-CF_3	C	F	H	170-174

[表30]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{5a}	融点(℃)
I-145	3-Fen	5-CF_3	O	H	H	228-231
I-146	CH_2SMe	5-CF_3	O	H	H	176-179
I-147	4-F-Ph	5-CF_3	O	H	H	222-226
I-148	3,5-$(MeO)_2$-Ph	5-CF_3	O	H	H	217-220
I-149	4-MeO-Ph	5-CH_3	O	H	H	210-213
I-150	D-8a	5-CF_3	O	H	H	244-243
I-151	CH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	H	187-190
I-152	N(Me)$CH_2C\equiv CH$	5-CF_3	O	H	Me	161-163
I-153	N(Me)$(CH_2)_2CN$	5-CF_3	O	H	Me	138-143
I-154	S(c-Pen)	5-CH_3	O	H	Me	152-155
I-155	S(c-Pen)	5-CF_3	O	H	H	214-218
I-156	SCH_2(D-8a)	5-CF_3	O	H	Me	171-172
I-157	SCH_2(D-8a)	5-CF_3	O	H	H	204-207
I-158	$CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	H	155-158(*3)
I-158*	CH-CHMe	5-CF_3	O	H	H	155-158(*3)
I-159	$CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	159-161(*4)
I-159*	CH-CHMe	5-CF_3	O	H	Me	159-161(*4)
I-160	$C\equiv CMe$	5-CF_3	O	H	H	>2
I-161	$C=CMe$	5-CF_3	O	H	Me	>280
I-162	CH_2CF_3	5-CF_3	O	H	Me	199-203
I-163	N(Me)$CH_2C\equiv CH$	5-CF_3	O	H	H	216-218
I-164	N(Me)$(CH_2)_2CN$	5-CF_3	O	H	H	105-110
I-165	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	136-139
I-166	N(Me)$CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	127-129
I-167	N(Me)CH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	191-194
I-168	CH_2CN	5-CF_3	O	H	Me	196-199
I-169	D-16m	5-CF_3	O	H	Me	146-147
I-170	D-24t	5-CF_3	O	H	Me	182-185
I-171	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	H	180-185
I-172	N(Me)$CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	H	135-137
I-173	$(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	157-158
I-174	D-16a	5-CF_3	O	Et	Me	>1

[0250] [第5表]

[化45]



[表31]

No	R^{1A}	$(R^2)_n$	X	R^4	R^{5A}	融点(℃)
2-001	H	5-CF_3	C	H	Me	247-251
2-002	Me	5-CF_3	C	H	Me	215-219
2-003	i-Pr	5-CF_3	C	H	Me	215-220
2-004	i-Pr	5-Cl	O	H	Me	189-190
2-005	c-Pr	5-CF_3	C	H	Me	190-195
2-006	3-Pen	5-CF_3	C	H	Me	143-144
2-007	Ph	5-CF_3	C	H	Me	245-247
2-008	Cl	5-CF_3	C	H	Me	193-195
2-009	Br	5-CF_3	C	H	Me	186-193
2-010	CH_2OMe	5-CF_3	O	H	Me	205-209
2-011	4-MeO-Ph	5-CF_3	C	H	Me	173-177
2-012	4-Cl-Ph	5-CF_3	C	H	Me	256-258
2-013	SMe	5-CF_3	C	H	Me	210-215
2-014	$CH_2O(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	C	H	Me	152-154
2-015	$CH_2OCH_2CF_3$	5-CF_3	C	H	Me	170-171
2-016	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	5-CF_3	C	H	Me	181-184
2-017	D-3a	5-CF_3	C	H	Me	251-253
2-018	i-Pr	6-CF_3	C	H	Me	169-171
2-019	n-Pr	5-CF_3	C	H	Me	149-150
2-020	CH_2OPh	5-CF_3	O	H	Me	116-117
2-021	c-Pen	5-CF_3	C	H	Me	197-201
2-022	D-5	5-CF_3	C	H	Me	147-149
2-023	i-Pr	5-CF_3	C	Me	Me	215-216
2-024	SEt	5-CF_3	C	H	Me	157-159
2-025	$SCH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	200-204
2-026	CH_2OEt	5-CF_3	O	H	Me	183-184
2-027	t-Bu	5-CF_3	C	H	Me	217-218
2-028	D-4a	5-CF_3	C	H	Me	186-188
2-029	CH_2SMe	5-CF_3	O	H	Me	189-191
2-030	$CH_2SCH_2CF_3$	5-CF_3	C	H	Me	155-158
2-031	S(O)Et	5-CF_3	C	H	Me	190-191
2-032	S(O)CH(CH$_3$)$_2$	5-CF_3	O	H	Me	163-167
2-033	$CH_2S(O)Me$	5-CF_3	O	H	Me	204-206
2-034	$CH_2S(O)_2Me$	5-CF_3	O	H	Me	212-214
2-035	$CH_2S(O)CH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	138-142
2-036	$CH_2S(O)_2CH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	176-178
2-037	$S(O)_2Me$	5-CF_3	O	H	Me	*1
2-038	$S(O)_2Et$	5-CF_3	O	H	Me	*1
2-039	i-Pr	5-CF_3	S	H	Me	198-200
2-040	$CH_2C(O)OEt$	5-CF_3	O	H	Me	202-204
2-041	i-Pr	5-CF_3	C	H	CH_2CH_2OMe	*1
2-042	4-Me-Ph	5-CF_3	C	H	Me	221-225
2-043	4-F-Ph	5-CF_3	C	H	Me	236-240
2-044	3-MeO-Ph	5-CF_3	C	H	Me	210-212
2-045	2-MeO-Ph	5-CF_3	C	H	Me	150-153
2-046	i-Pr	5-CF_3	C	H	$CH_2C(O)OMe$	149-154
2-047	i-Pr	5-CF_2H	C	H	Me	172-173
2-048	i-Pr	5-CF_3	C	H	CH_2CH_2SMe	*1

[表32]

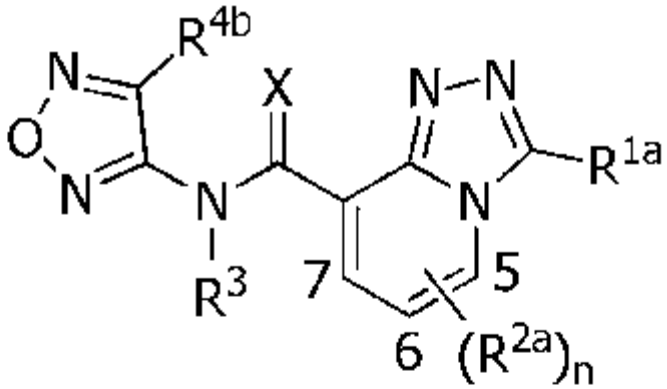
No	R^{1c}	$(R^{3c})_n$	X	R^4	R^{5c}	融点(℃)
2-049	i-Pr	5-CF_2CF_3	C	H	Me	240-241
2-050	i-Pr	5-CH_2-6-Me	O	H	Me	208-209
2-051	NMe_2	5-CF_3	C	H	Me	222-225
2-052	CH(Me)SMe	5-CF_3	O	H	Me	202-204
2-053	CH(Me)S(O)Me	5-CF_3	O	H	Me	150-152
2-054	CH(Me)S(O)$_2$Me	5-CF_3	C	H	Me	117-125
2-055	i-Pr	5-Ph	O	H	Me	193-198
2-056	NHPh	5-CF_3	O	H	Me	255-260
2-057	$(CH_2)_2$SMe	5-CF_3	O	H	Me	144-146
2-058	$(CH_2)_2$S(O)Me	5-CF_3	O	H	Me	96-102
2-059	$(CH_2)_2$S(O)$_2$Me	5-CF_3	O	H	Me	173-175
2-060	D-8a	5-CF_3	O	H	Me	217-220
2-061	D-11	5-CF_3	O	H	Me	223-224
2-062	D-10a	5-CF_3	O	H	Me	246-248
2-063	3,5-$(MeC)_2$-Ph	5-CF_3	C	H	Me	197-199
2-064	3,5-$(Cl)_2$-Ph	5-CF_3	C	H	Me	269-271
2-065	CH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	C	H	Me	167-168
2-066	$NHCH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	104-107
2-067	S(O)Me	5-CF_3	O	H	Me	228-229
2-068	$S(CH_2)_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	136-138
2-069	$S(O)(CH_2)_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	155-157
2-070	$S(O)_2(CH_2)_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	203-205
2-071	$SCH_2CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	159-160
2-072	$SCH(CH_3)CH_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	170-173
2-073	i-Pr	5-CF_3	O	H	Ph	133-136
2-074	$NH(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	111-115
2-075	D-14	5-CF_3	O	H	Me	240-245
2-076	SCH_2Ph	5-CF_3	C	H	Me	179-181
2-077	SCH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	C	H	Me	190-192
2-078	D-17	5-CF_3	O	H	Me	285-290
2-079	$N(Me)(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	168-169
2-080	$NH(CH_2)_2SMe$	5-CF_3	O	H	Me	*1
2-081	$NHCH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	*1
2-082	$N(Me)CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	171-172
2-083	N(Me)(c-Hex)	5-CF_3	O	H	Me	144-145
2-084	SCH_2(c-Pr)	5-CF_3	C	H	Me	168-169
2-085	SCH_2(D-15)	5-CF_3	C	H	Me	139-141
2-086	SCH_2CN	5-CF_3	C	H	Me	144-145
2-087	SCH_2CF_3	5-CF_3	O	H	Me	160-161
2-088	N(Me)Et	5-CF_3	O	H	Me	110-112
2-089	$N(Et)_2$	5-CF_3	C	H	Me	159-160
2-090	i-Pr	5-CF_3	O	H	n-Pr	111-112
2-091	i-Pr	5-CF_3	O	H	$CH_2CH=CH_2$	118-119
2-092	i-Pr	5-CF_3	O	H	$CH_2C(O)OEt$	104-105
2-093	i-Pr	5-CF_3	O	H	CH_2(4-Cl-Ph)	147-148
2-094	$N(Me)CH_2C\equiv CH$	5-CF_3	C	H	Me	176-178
2-095	$N(Me)(CH_2)_2CN$	5-CF_3	O	H	Me	125-128
2-096	S(c-Pen)	5-CF_3	O	H	Me	192-194

[表33]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{4b}	融点(℃)
2-097	SCH_2(D-8a)	5-CF_3	O	H	Me	176-178
2-098	SEt	5-CF_3	O	H	CH_2CH_2OMe	130-131
2-099	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	141-142
2-100	N(Me)$CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	183-184
2-101	S$(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	144-145
2-102	$SCH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	172-174
2-103	$SCH_2C\equiv CH$	5-CF_3	O	H	Me	190-191
2-104	i-Pr	5-CF_3	O	H	F	276-280
2-105	$CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	164-167(*5)
2-105*	CH=CHMe	5-CF_3	O	H	Me	164-167(*5)
2-106	$C\equiv CMe$	5-CF_3	O	H	Me	244-246
2-107	$CH_2OC(O)Me$	5-CF_3	O	H	Me	176-178
2-108	CH_2OH	5-CF_3	O	H	Me	155-158
2-109	CHO	5-CF_3	O	H	Me	250-252
2-110	D-16a	5-CF_3	O	H	Me	194-201

[0251] [第6表]

[化46]

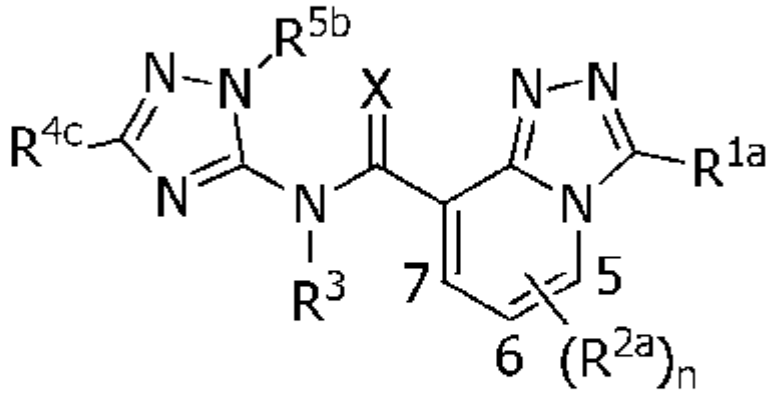


[表34]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{4b}	融点(℃)
3-001	i-Pr	5-CF_3	O	H	Me	185-186
3-002	$SCH_2CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	136-137

[0252] [第7表]

[化47]

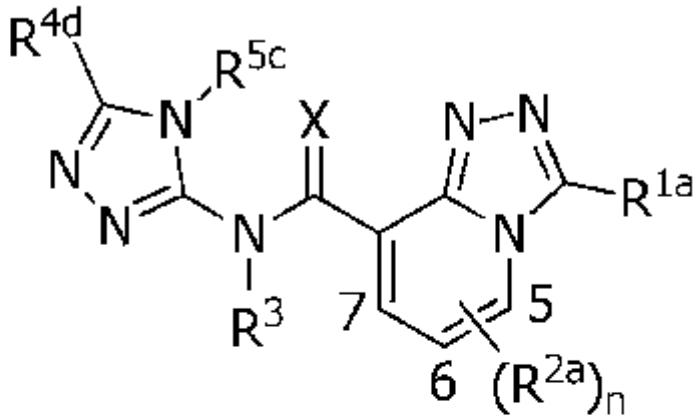


[表35]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{4c}	R^{5b}	融点(℃)
4-001	i-Pr	5-CF_3	O	H	H	Me	182-185
4-002	i-Pr	5-CF_3	O	H	H	Et	*
4-003	SEt	5-CF_3	O	H	H	Me	119-120
4-004	i-Pr	5-CF_3	O	H	H	H	250-255

[0253] [第8表]

[化48]

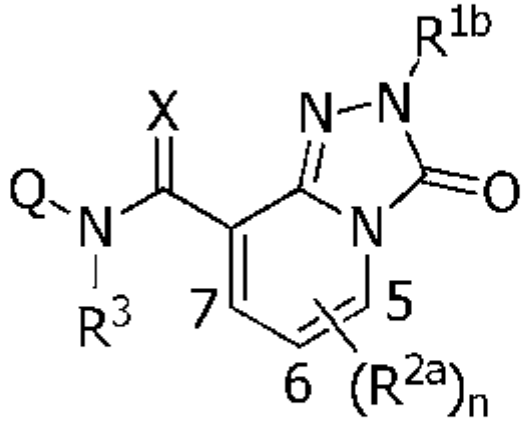


[表36]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{4d}	R^{5c}	融点(℃)
5-001	i-Pr	5-CF_3	O	H	Me	Me	215-220
5-002	i-Pr	5-CF_3	O	H	-CH-CH-CH-CH-		219-223
5-003	i-Pr	5-CF_3	O	H	-$(CH_2)_4$-		130-135

[0254] [第9表]

[化49]

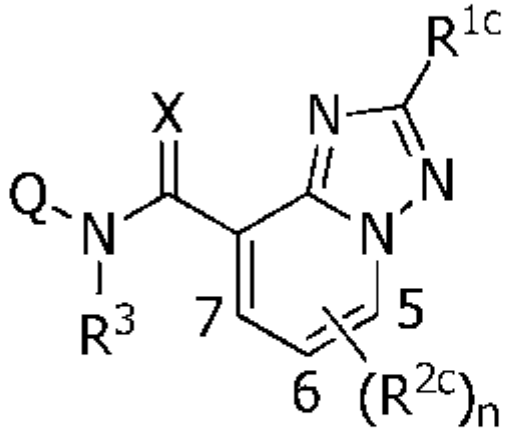


[表37]

No.	G	R^1	$(R^{2a})_n$	X	R^3	融点(℃)
6-001	D-6a	Me	5-CF_3	O	H	250-250
6-002	D-7a	Me	5-CF_3	O	H	245-246
6-003	D-6a	Et	5-CF_3	O	H	234-236
6-004	D-7a	Et	5-CF_3	O	H	176-178
6-005	D-6a	i-Pr	5-CF_3	O	H	184-190
6-006	D-6a	CH_2Ph	5-CF_3	O	H	155-162
6-007	D-23a	Et	5-CF_3	O	H	182-185
6-008	D-23a	Et	5-CF_3	O	H	162-164

[0255] [第10表]

[化50]



[表38]

No	Q	R^{1a}	$(R^{4a})_n$	X	R^5	融点(℃)
7-001	D-3a	i-Pr	5-CF_3	C	H	252-255
7-002	D-7a	i-Pr	5-CF_3	C	H	168-170

[0256] 本発明化合物のうち、融点の記載のない化合物及び「＊３」、「＊４」及び「＊５」記載の異性体混合物の^{1}Ｈ－ＮＭＲデータを第１１表に示す。

尚、プロトン核磁気共鳴ケミカルシフト値は、基準物質としてMe_4Si（テトラメチルシラン）を用い、重クロロホルム溶媒中で、３００ＭＨｚにて測定した。また、第４表の記号は下記の意味を表す。ｓ：シングレット、ｂｒｓ：ブロードシングレット、ｄ：ダブレット、ｄｄ：ダブルダブレット、ｔ：トリプレット、ｑ：カルテット、ｍ：マルチプレット。

[0257] 〔第１１表〕

[表39]

No	^{1}H-NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz)
1-003	δ 8.27 (d, 1H, J=7.2Hz), 6.77 (d, 1H, J=7.2Hz), 3.85-3.70 (m, 1H), 2.97 (s, 3H), 2.55 (s, 3H), 1.58 (d, 6H, J=7.2Hz)。
1-009	δ 8.24 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.67 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.92 (brs, 1H), 4.25-4.10 (m, 1H), 2.75 (s, 3H), 2.55 (s, 3H), 1.60 (d, 6H, J=6.9Hz)。
1-037	δ 8.57 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.72 (d, 1H, J=6.9Hz), 5.05 (s, 2H), 3.23 (s, 3H), 2.60 (s, 3H)。(CONHのプロトンピークは観測されなかった。)
1-039	δ 8.54 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.78 (d, 1H, J=7.5Hz), 5.17 (s, 2H), 4.35 (q, 2H, J=9.0Hz), 2.60 (s, 3H)。(CONHのプロトンピークは観測されなかった。)
1-040	δ 8.54 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.79 (d, 1H, J=7.2Hz), 3.78 (s, 3H), 2.60 (s, 3H)。(CONHのプロトンピークは観測されなかった。)
1-041	δ 8.53 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.78 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.00 (q, 2H, J=7.5Hz), 2.60 (s, 3H), 1.59(t, 3H, J=7.5Hz)。(CONHのプロトンピークは観測されなかった。)
1-098	δ 8.34 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.59 (d, 1H, J=7.5Hz), 3.82 (t, 4H, J=4.9Hz), 3.79-3.68 (m, 1H), 3.54 (t, 4H, J=4.9Hz), 1.56(d, 6H, J=6.5Hz)。(CONHのプロトンピークは観測されなかった。)
1-118	δ 12.68 (brs, 1H), 8.39 (d, 1H, J=7.4Hz), 7.59 (d, 1H, J=7.4Hz), 3.59 3.39 (m, 4H), 3.05 2.78 (m, 4H), 2.59 (s, 3H)。
1-158	δ 13.1 (brs, 1H), 8.44 (d, 1H, J=7.5Hz) 6.30 (s, 1H), 7.64 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.38-6.25 (m, 1H), 5.38-5.24 (m, 2H), 4.04 (dd, 2H, J=3.9Hz, 1.2Hz)。
1-158*	δ 13.0 (brs, 1H), 8.43 (d, 1H, J=6.6Hz), 8.30 (s, 1H), 7.62 (d, 1H, J=6.6Hz), 7.11-7.01 (m, 1H), 6.71-6.61(m, 1H), 2.10 (d, 3H, J=6.6Hz)。
1-159	δ 12.9 (brs, 1H), 8.42 (d, 1H, J=7.5Hz) 7.63 (s, 1H, J=7.5Hz), 6.38-6.24 (m, 1H), 5.36-5.23 (m, 2H), 4.03 (dd, 2H, J=6.3Hz, 1.2Hz), 2.59 (s, 3H)。
1-159*	δ 12.9 (brs, 1H), 8.38 (d, 1H, J=6.9Hz) 7.60 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.12-7.00 (m, 1H), 6.69-6.62 (m, 1H), 2.60 (s, 3H), 2.09 (dd, 3H, J=6.6Hz, 1.8Hz)。
1-160	δ 12.8 (brs, 1H), 8.46 (d, 1H, J=7.2Hz) 8.31 (s, 1H), 7.65 (d, 1H, J=7.2Hz), 2.27 (s, 3H)。
1-161	δ 12.6 (brs, 1H), 8.44 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.64 (s, 1H, J=7.2Hz), 2.59 (s, 3H), 2.27 (s, 3H)。
1-174	δ 7.72 (d, 1H, J=7.8Hz), 7.53 (d, 1H, J=7.8Hz), 4.15 (q, 2H, J=7.2Hz), 2.78 (d, 1H, J=7.8Hz), 2.38 (s, 3H), 1.83 (d, 1H, J=7.8Hz), 1.80 (s, 3H), 1.43 (t, 3H, J=7.2Hz)。
2-037	δ 12.08 (brs, 1H), 8.62 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.86 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.12 (s, 3H), 3.80 (s, 3H)。
2-038	δ 12.11 (brs, 1H), 8.62 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.86 (d, 1H, J=7.2Hz), 4.12 (s, 3H), 4.01 (q, 2H, J=7.2Hz), 1.60 (t, 3H, J=7.2Hz)。
2-041	δ 12.49 (brs, 1H), 8.35 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.62 (d, 1H, 7.5Hz), 4.65-4.55 (m, 2H), 3.90-3.80 (m, 2H), 3.75-3.65 (m, 1H), 3.38 (s, 3H), 1.60-1.50(m, 6H)。

[表40]

No.	^{1}H-NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz)
2-048	δ 12.6 (brs, 1H), 8.35 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.54 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.60 (t, 2H, J=7.2Hz), 3.80-3.65 (m, 1H), 3.09 (t, 2H, J=7.2Hz), 2.11 (s, 3H), 1.56 (d, 6H, J=6.9Hz)。
2-080	δ 12.4 (brs, 1H), 8.14 (d, 1H, J=6.6Hz), 7.40 (d, 1H, J=6.6Hz), 5.24 (brs, 1H), 4.11 (s, 3H), 3.88-3.80 (m, 2H), 2.99-2.91 (m, 2H), 2.16 (s, 3H)。
2-081	δ 12.3 (brs, 1H), 8.23 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.49 (d, 1H, J=7.2Hz), 4.78 (brs, 1H), 4.45-4.32 (m, 2H), 4.11 (s, 3H)。
2-105	δ 12.5 (brs, 1H), 8.40 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.65 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.37-6.24 (m, 1H), 5.37-5.24 (m, 2H), 4.13 (s, 3H), 4.06 (dd, 2H, J=6.6Hz, 1.2Hz)。
2-105*	δ 12.5 (brs, 1H), 8.36 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.62 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.13-7.01 (m, 1H), 6.70-6.62 (m, 1H), 4.13 (s, 3H), 2.10 (dd, 3H, J=6.6Hz, 1.5Hz)。
4-002	δ 12.3 (brs, 1H), 8.37 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.58 (s, 1H), 7.61 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.23 (q, 2H, J=7.5Hz), 3.80-3.60 (m, 1H), 1.60-1.50 (m, 9H)。

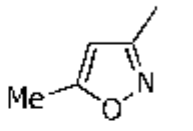
[0258] 参考例

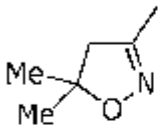
〔参考例１〕

合成例７の工程１と同様の方法で、第１２表に示す化合物を合成した。尚、表中Ｍｅとの記載はメチル基を表し、以下同様にＥｔはエチル基を、Ｐｒはプロピル基を、Ｐｅｎはペンチル基を、Ｐｈはフェニル基を、Ｂｎはベンジル基を、ｎ－はノルマルを、ｉ－はイソを、ｃ－はシクロ及びｔ－はターシャリーを各々意味する。

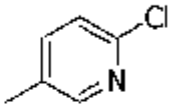
また、表中Ｄ－３ａ、Ｄ－４ａ、Ｄ－５、Ｄ－８ａ、Ｄ－９ａ、Ｄ－１０ａ、Ｄ－１１、Ｄ－１２、Ｄ－１３ａ、Ｄ－１４、Ｄ－１６ａ及びＤ－１６ｍで表される置換基は、以下の構造を表す。

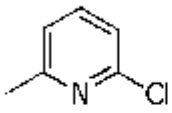
[化51]

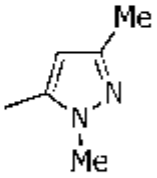

D-3a

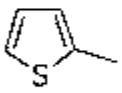

D-4a

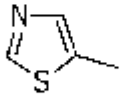
D-5

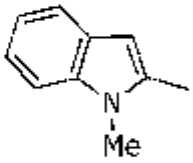

D-8a

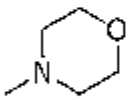

D-9a

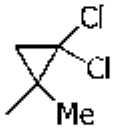

D-10a

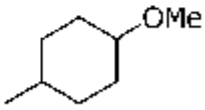

D-11


D-12


D-13a


D-14

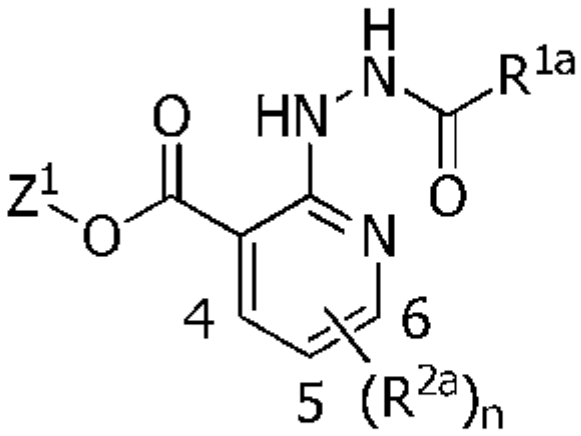

D-16a


D-16m

[0259] 尚、表中、「＊１」は「楔脂状」を表す。融点の記載のない化合物の１Ｈ－ＮＭＲデータを第１６表に示す。尚、第１６表におけるプロトン核磁気共鳴ケミカルシフト値は、基準物質としてＭｅ４Ｓｉ（テトラメチルシラン）を用い、重クロロホルム溶媒中で、３００ＭＨｚにて測定した。また、第１６表の記号は下記の意味を表す。ｓ：シングレット、ｂｒｓ：ブロードシングレット、ｄ：ダブレット、ｄｄ：ダブルダブレット、ｔ：トリプレット、ｑ：カルテット、ｍ：マルチプレット。

[0260] 〔第１２表〕

[化52]



[表41]

No	R[1]	(R[2])n	Z	融点(℃)
A1-01a	H	6-CF_3	Me	oil
A1-02a	c-Pr	6-CF_3	Me	143-144
A1-03a	3-Pen	6-CF_3	Me	125-126
A1-04a	Ph	6-CF_3	Me	oil
A1-05a	CH_2OMe	6-CF_3	Me	76－77
A1-06a	4-MeO-Ph	6-CF_3	Me	116-120
A1-07a	4-Cl-Ph	6-CF_3	Me	163-165
A1-08a	$CH_2O(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	Me	oil
A1-09a	$CH_2OCH_2CF_3$	5-CF_3	Me	82-85
A1-10a	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	5-CF_3	Me	148-149
A1-11a	D-3a	6-CF_3	Me	121-122
A1-12a	i-Pr	5-CF_3	Me	130-131
A1-13a	n-Pr	6-CF_3	Me	119-120
A1-14a	CH_2OPh	6-CF_3	Me	95-97
A1-15a	c-Pen	6-CF_3	Me	158-159
A1-16a	D-5	6-CF_3	Me	155-156
A1-17a	CH_2OEt	6-CF_3	Me	55-57
A1-18a	L-Bu	6-CF_3	Me	144-146
A1-19a	D-4a	6-CF_3	Me	99-100
A1-20a	CH_2SMe	6-CF_3	Me	127-129
A1-21a	$CH_2SCH_2CF_3$	5-CF_3	Me	114-116
A1-22b	$CH_2C(O)OEt$	6-CF_3	Bn	110-112
A1-23a	4-Me-Ph	6-CF_3	Me	183-185
A1-24a	4-F-Ph	6-CF_3	Me	117-119
A1-25a	4-CF_3-Ph	6-CF_3	Me	160-162
A1-26a	3-MeO-Ph	6-CF_3	Me	103-106
A1-27a	2-MeO-Ph	6-CF_3	Me	160-164
A1-28a	i-Pr	6-CF_2H	Me	140-141
A1-29a	D-6a	6-CF_3	Me	172-175
A1-30a	D-9a	6-CF_3	Me	160-170
A1-31a	D-10a	6-CF_3	Me	161-163
A1-32a	D-11	6-CF_3	Me	45-50
A1-33a	D-12	6-CF_3	Me	40-45
A1-34a	D-13a	6-CF_3	Me	183-184
A1-35b	$CH_2OC(O)Me$	6-CF_3	Bn	89-91
A1-36a	CH_2(4-MeO-Ph)	6-CF_3	Me	121-122
A1-37c	i-Pr	6-CF_2CF_3	Et	120-121
A1-38a	3,5-$(MeO)_2$-Ph	6-CF_3	Me	106-107
A1-39a	3,5-$(Cl)_2$-Ph	6-CF_3	Me	178-179
A1-40a	i-Pr	5-Me-6-CF_3	Me	169-174
A1-41c	i-Pr	4-Me-6-CF_3	Et	140-141
A1-42a	$(CH_2)_2SMe$	6-CF_3	Me	90-91
A1-43a	CH(Me)SMe	6-CF_3	Me	166-167
A1-44c	i-Pr	6-Ph	Et	144-146
A1-45c	i-Pr	6-{3,5-$(F)_2$-Ph}	Et	144-146
A1-46a	NMe_2	6-CF_3	Me	134-137
A1-47c	D-14	6-CF_3	Et	101-105
A1-48a	CH_2(c-Pr)	6-CF_3	Me	119-122

[表42]

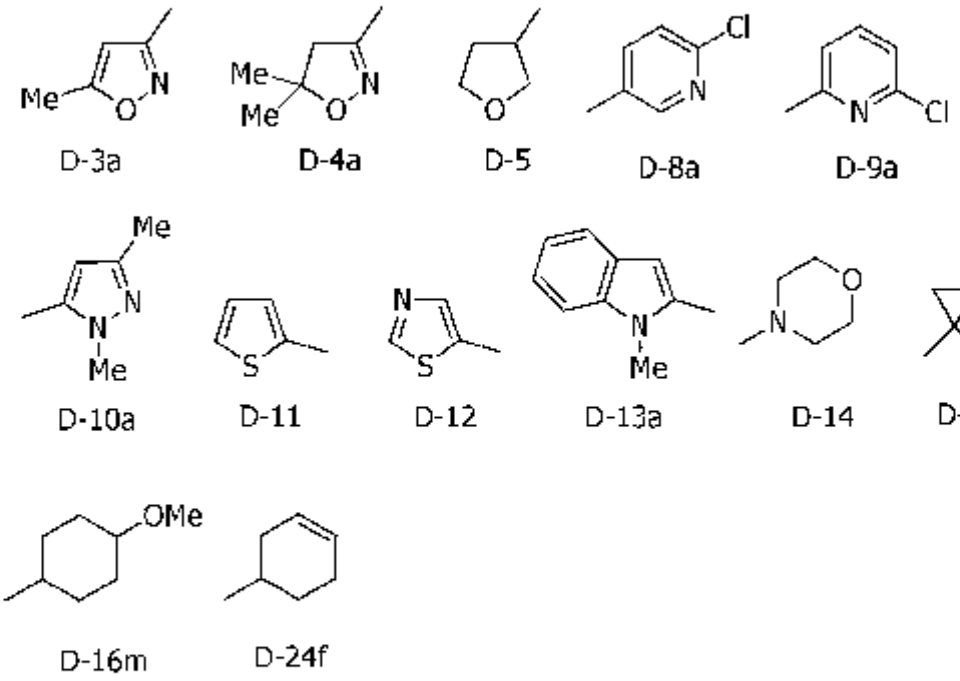
No.	R^{14}	$(R^{24})n$	Z	融点(℃)
A1-49a	D-16a	6-CF_3	Me	70-75
A1-50a	C≡CMe	6-CF_3	Me	151-153
A1-51a	CH_2CF_3	6-CF_3	Me	170-172
A1-52a	CH_2CN	6-CF_3	Me	163-165
A1-53c	D-16m	6-CF_3	Et	120-125
A1-55c	$(CH_2)_2OMe$	6-CF_3	Et	95-98

[0261] [参考例２]

合成例７の工程２と同様の方法で、第１３表に示す化合物を合成した。尚、表中Ｍｅとの記載はメチル基を表し、以下同様にＥｔはエチル基を、Ｐｒはプロピル基を、Ｐｅｎはペンチル基を、Ｐｈはフェニル基を、Ｂｎはベンジル基を、ｎ－はノルマルを、ｉ－はイソを、ｃ－はシクロ及びｔ－はターシャリーを各々意味する。

また、表中Ｄ－３ａ、Ｄ－４ａ、Ｄ－５、Ｄ－８ａ、Ｄ－９ａ、Ｄ－１０ａ、Ｄ－１１、Ｄ－１２、Ｄ－１３ａ、Ｄ－１４、Ｄ－１６ａ、Ｄ－１６ｍ及びＤ－２４ｆで表される置換基は、以下の構造を表す。

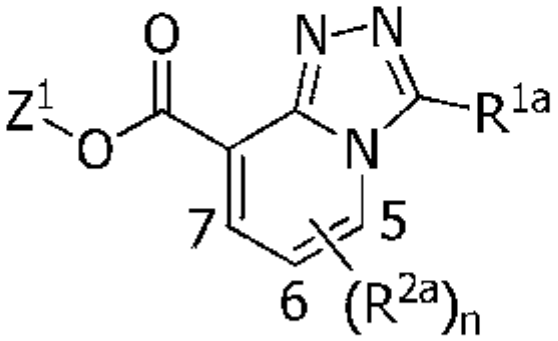
[化53]



[0262] 尚、表中、「＊１」は「樹脂状」を表す。融点の記載のない化合物の^{1}Ｈ－ＮＭＲデータを第１６表に示す。

[0263] 〔第１３表〕

[化54]



[表43]

No.	R^{14}	$(R^{15})n$	Z^1	融点(℃)
B1-01a	H	5-CF_3	Me	*1
B1-02a	c-Pr	5-CF_3	Me	*1
B1-04a	Ph	5-CF_3	Me	*1
B1-05a	CH_2CMe	5-CF_3	Me	95-97
B1-06a	4-MeO-Ph	5-CF_3	Me	160-162
B1-07a	4-Cl-Ph	5-CF_3	Me	148-152
B1-08a	$CH_3C(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	Me	*1
B1-09a	$CH_2CCH_2CF_3$	5-CF_3	Me	87-89
B1-10a	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	5-CF_3	Me	86-94
B1-11a	D-3a	5-CF_3	Me	140-141
B1-12a	i-Pr	6-CF_3	Me	105-107
B1-13a	n-Pr	5-CF_3	Me	129-130
B1-14a	CH_2CPh	5-CF_3	Me	102-103
B1-15a	c-Pen	5-CF_3	Me	130-134
B1-17a	CH_2CEt	5-CF_3	Me	87-89
B1-18a	t-Bu	5-CF_3	Me	75-77
B1-19a	D-4a	5-CF_3	Me	137-139
B1-20a	CH_2SMe	5-CF_3	Me	97-99
B1-21a	$CH_2SCH_2CF_3$	5-CF_3	Me	125-126
B1-22b	$CH_2C(O)OEt$	5-CF_3	Bn	72-73
B1-23a	4-Me-Ph	5-CF_3	Me	142-145
B1-24a	4-F-Ph	5-CF_3	Me	133-135
B1-25a	4-CF_3-Ph	5-CF_3	Me	170-171
B1-26a	3-MeO-Ph	5-CF_3	Me	135-142
B1-27a	2-MeO-Ph	5-CF_3	Me	*1
B1-28a	i-Pr	5-CF_2H	Me	142-145
B1-29a	D-8a	5-CF_3	Me	*1
B1-30a	D-9a	5-CF_3	Me	140-145
B1-31a	D-10a	5-CF_3	Me	126-129
B1-32a	D-11	5-CF_3	Me	122-124
B1-33a	D-12	5-CF_3	Me	171-172
B1-34a	D-13a	5-CF_3	Me	*1
B1-35b	$CH_2CC(O)Me$	5-CF_3	Bn	88-89
B1-36a	CH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	Me	92-110
B1-37c	i-Pr	5-CF_2CF_3	Et	57-58
B1-38a	3,5-$(MeO)_2$-Ph	5-CF_3	Me	150-161
B1-39a	3,5-$(Cl)_2$-Ph	5-CF_3	Me	157-164
B1-40a	i-Pr	5-CF_3-3-Me	Me	58-59
B1-41c	i-Pr	5-CF_3-7-Me	Et	76-77
B1-42a	$(CH_2)_2SMe$	5-CF_3	Me	126-127
B1-43a	CH(Me)SMe	5-CF_3	Me	103-104
B1-44c	i-Pr	5-Ph	Et	133-134
B1-45c	i-Pr	5-[3,5-$(F)_2$-Ph]	Et	125-127
B1-46a	NMe_2	5-CF_3	Me	135-137
B1-47c	D-14	5-CF_3	Et	138-139
B1-48a	CH_2(c-Pr)	5-CF_3	Me	130-135
B1-49a	D-16a	5-CF_3	Me	*1
B1-50a	C≡CMe	5-CF_3	Me	163-168

[表44]

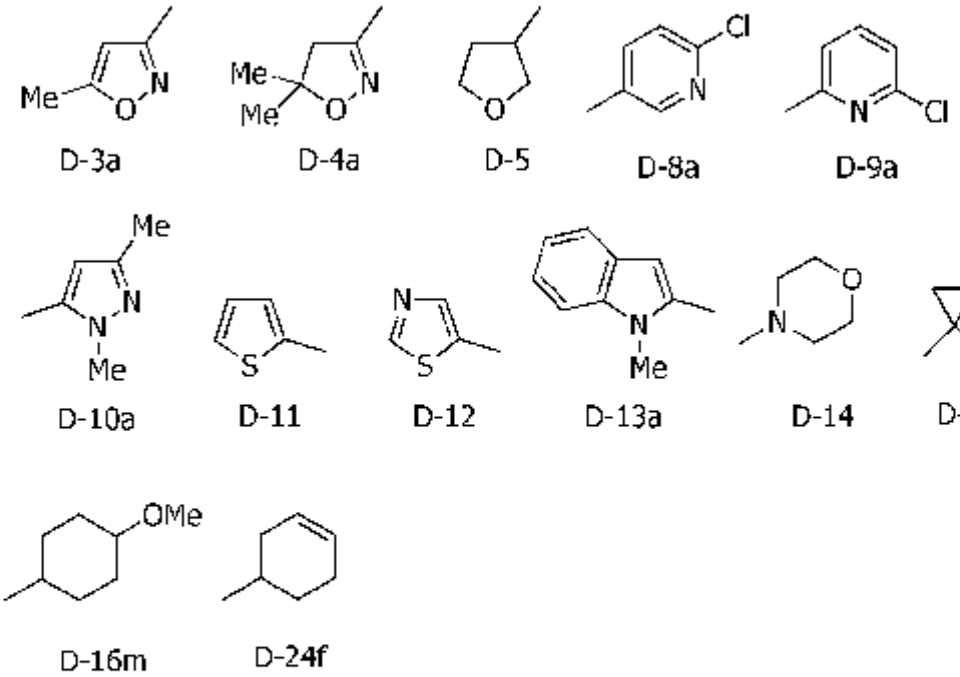
No.	R1*	(R2*)n	Z1	融点(℃)
B1-51a	CH_2CF_3	5-CF_3	Me	160-164
B1-52a	CH_2CN	5-CF_3	Me	165-170
B1-53c	c-Pr	5-CF_3	Et	95-102
B1-54c	D-24f	5-CF_3	Et	101-110
B1-55c	$(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	Et	82-83

[0264] 〔参考例３〕

合成例７の工程３と同様の方法で、第１４表に示す化合物を合成した。尚、表中Ｍｅとの記載はメチル基を表し、以下同様にＥｔはエチル基を、Ｐｒはプロピル基を、Ｐｅｎはペンチル基を、Ｐｈはフェニル基を、Ｂｎはベンジル基を、ｎ－はノルマルを、ｉ－はイソを、ｃ－はシクロ及びｔ－はターシャリーを各々意味する。

また、表中Ｄ－３ａ、Ｄ－４ａ、Ｄ－５、Ｄ－８ａ、Ｄ－９ａ、Ｄ－１０ａ、Ｄ－１１、Ｄ－１２、Ｄ－１３ａ、Ｄ－１４、Ｄ－１６ａ、Ｄ－１６ｍ及びＤ－２４ｆで表される置換基は、以下の構造を表す。

[化55]

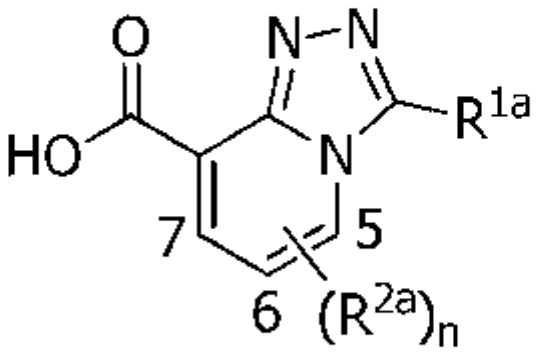


[0265] 尚、表中、「＊１」は「樹脂状」を表す。融点の記載のない化合物のＨ－

ＮＭＲデータを第１６表に示す。

[0266] 〔第１４表〕

[化56]



[表45]

No.	R1*	(R2*)n	融点(℃)
C1-01	H	5-CF3	*1
C1-02	c-Pr	5-CF3	*1
C1-03	3-Pen	5-CF3	137-139
C1-04	Ph	5-CF3	*1
C1-05	CH2OMe	5-CF3	111-112
C1-06	4-MeO-Ph	5-CF3	215-218
C1-07	4-Cl-Ph	5-CF3	241-247
C1-08	CH3O(CH2)2OMe	5-CF3	47-49
C1-09	CH3OCH2CF3	5-CF3	67-70
C1-10	CH(CH3)CH2CH3	5-CF3	137-140
C1-11	D-3a	5-CF3	197-201
C1-12	i-Pr	6-CF3	224-225
C1-13	n-Pr	5-CF3	134-135
C1-14	CH2OPh	5-CF3	136-140
C1-15	c-Pen	5-CF3	156-158
C1-16	D-5	5-CF3	195-200
C1-17	CH2OEt	5-CF3	96-97
C1-18	t-Bu	5-CF3	125-131
C1-19	D-4a	5-CF3	184-185
C1-20	CH2SMe	5-CF3	110-111
C1-21	CH2SCH2CF3	5-CF3	56-59
C1-22	CH2C(O)OEt	5-CF3	124-126
C1-23	4-Me-Ph	5-CF3	250-253
C1-24	4-F-Ph	5-CF3	249-251
C1-25	4-CF3-Ph	5-CF3	199-201
C1-26	3-MeO-Ph	5-CF3	179-181
C1-27	2-MeO-Ph	5-CF3	85-90
C1-28	i-Pr	5-CH2F	193-195
C1-29	D-8a	5-CF3	237-240
C1-30	D-9a	5-CF3	231-234
C1-31	D-10a	5-CF3	215-220
C1-32	D-11	5-CF3	190-195
C1-33	D-12	5-CF3	218-223
C1-34	D-13a	5-CF3	185-188
C1-35	CH2OC(O)Me	5-CF3	126-128
C1-36	CH2(4-MeO-Ph)	5-CF3	73-75
C1-37	i-Pr	5-CF2CF3	170-175
C1-38	3,5-(MeO)2-Ph	5-CF3	158-160
C1-39	3,5-(Cl)2-Ph	5-CF3	250-252
C1-40	i-Pr	5-CF3-6-Me	153-154
C1-41	i-Pr	5-CF3-7-Me	190-192
C1-42	(CH2)2SMe	5-CF3	149-151
C1-43	CH(Me)SMe	5-CF3	145-146
C1-44	i-Pr	5-Ph	218-219
C1-45	i-Pr	5-[3,5-(F)2-Ph]	210-220
C1-46	NMe2	5-CF3	181-183
C1-47	D-14	5-CF3	210-213
C1-48	CH2(c-Pr)	5-CF3	109-114

[表46]

No.	R^{12}	$(R^{22})n$	融点(℃)
C1-48	D-16a	5-CF_3	159-164
C1-50	C≡CMe	5-CF_3	234-238
C1-51	CH_2CF_3	5-CF_3	168-171
C1-52	CH_2CN	5-CF_3	227-231
C1-53	D-16m	5-CF_3	118-120
C1-54	D-24	5-CF_3	169-170
C1-55	$(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	104-105

[0267] 〔参考例４〕

３－（エチルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

工程１；３－（チオキソ）－５－（トリフルオロメチル）－２，３－ジヒドロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸の合成

合成例８の工程１と同様にして合成したイミダゾールを含む３－チオキソ－５－（トリフルオロメチル）－２，３－ジヒドロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル２．０ｇのメタノール２０ｍｌ溶液に、０．５ｍｏｌ／Ｌの水酸化ナトリウム水溶液を氷冷下にて１７ｍｌ添加した。添加終了後、該反応溶液を室温にて３．５時間撹拌した。反応終了後、該反応溶液に１ｍｏｌ／Ｌ塩酸２０ｍｌを添加し、該反応溶液中に析出した固体をろ別した。得られた固体を１ｍｏｌ／Ｌ塩酸、水、ジイソプロピルエーテルの順で洗浄し、濾取することにより目的物１．１ｇを黄色固体として得た。

融点：２３５～２４０℃

[0268] 工程２；３－（エチルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸の合成

３－（チオキソ）－５－（トリフルオロメチル）－２，３－ジヒドロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸７００ｍｇ（２．６６ｍｍｏｌ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド１０ｍｌ溶液に、

室温にてヨウ化エチル８９８ｍｇ（５，７６ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応溶液を室温にて４日間撹拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した。得られた残渣に、水５ｍｌ、１ｍｏｌ／ｌ塩酸５ｍｌを添加し、析出した固体をろ別した。得られた固体を水、ジイソプロピルエーテルの順で洗浄することにより、目的物４８６ｍｇを黄色固体として得た。

融点：１１３～１１４℃

[0269] 〔参考例５〕

合成例８の工程２及び工程３、または参考例４と同様の方法で以下の化合物を合成した。

３－（イソプロピルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル

融点：１２０～１２２℃

３－（イソプロピルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：１３５～１３６℃

３－（（２－メトキシエチル）チオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：１０６～１１１℃

３－（アリルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：９６～９９℃

３－（プロプ－２－イン－１－イルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：１７９～１８１℃

３－（ｎ－プロピルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル

融点：８７～８８℃

３－（ｎ－プロピルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：１０６～１０８℃

３－（イソブチルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル

融点：１０５～１０６℃

３－（イソブチルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：１１０～１１２℃

３－（ｓ－ブチルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル

融点：８８～９０℃

３－（ｓ－ブチルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：１０７～１０９℃

３－（ベンジルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル

融点：１３０～１３５℃

３－（ベンジルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：１５３～１５６℃

３－（（４－メトキシベンジル）チオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル

融点：１１９～１２１℃

３－（（４－メトキシベンジル）チオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：１８０～１８２℃

３－（（シクロプロピルメチル）チオ）－５－（トリフルオロメチル）－

［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル

融点：１２２～１２３℃

３－（（シクロプロピルメチル）チオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：１２７～１２９℃

３－（（（テトラヒドロフラン－２－イル）メチル）チオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル

^{1}H NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ7.95 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.42 (d, 1H, J=7.2Hz), 4.34-4.25 (m, 1H), 4.09 (s, 3H), 3.92-3.84 (m, 1H), 3.79-3.68 (m, 2H), 3.56-3.49 (m, 1H), 2.17-2.06 (m, 1H), 1.99-1.87 (m, 2H), 1.76-1.68 (m, 1H)。

３－（（（テトラヒドロフラン－２－イル）メチル）チオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：１０８～１１２℃

３－（（シアノメチル）チオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル

融点：１４６～１４８℃

３－（（シアノメチル）チオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：１３８～１４０℃

３－（（２－オキソプロピル）チオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル

融点：８４～８７℃

３－（（２－オキソプロピル）チオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：１２１～１２４℃

３－（（（１，３－ジオキソラン－２－イル）メチル）チオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル

融点：９９～１０２℃

３－（（（１，３－ジオキソラン－２－イル）メチル）チオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：１１０～１１２℃

３－（（２，２，２－トリフルオロエチル）チオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：１５０～１５１℃

３－（（２－メトキシ－２－オキソエチル）チオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：１４３～１４４℃

３－（シクロペンチルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル

融点：９２～９４℃

３－（シクロペンチルチオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：１４３～１４６℃

３－（（（６－クロロピリジン－３－イル）メチル）チオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル

融点：９９～１００℃

３－（（（６－クロロピリジン－３－イル）メチル）チオ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８

ーカルボン酸

融点：１５９～１６０℃

[0270] 〔参考例６〕

２－メチル－３－オキソ－５－（トリフルオロメチル）－２，３－ジヒドロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチルの合成

３－オキソ－５－（トリフルオロメチル）－２，３－ジヒドロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル５００ｍｇ（１．９１ｍｍｏｌ）、炭酸カリウム５２５ｍｇ（３．８２ｍｍｏｌ）及びアセトニトリル１０ｍｌの混合物に、室温にてヨウ化メチル２９８ｍｇ（２．１０ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応溶液を室温にて５時間撹拌した。反応終了後、該反応溶液にクロロホルム２０ｍｌを添加した後、析出した固体をろ別した。ろ別により得られた溶液を減圧下にて溶媒を留去した。溶媒を留去した後に得られた残渣をｎ－ヘキサン－酢酸エチル（１７：３～２：３のグラジエント）にて溶出する中圧分取液体クロマトグラフィーにて精製し、目的物３１２ｍｇを黄色固体として得た。

融点：１８９～１９０℃

[0271] 同様の方法で以下の化合物を合成した。

２－エチル－３－オキソ－５－（トリフルオロメチル）－２，３－ジヒドロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル

融点：１３５～１３７℃

２－イソプロピル－３－オキソ－５－（トリフルオロメチル）－２，３－ジヒドロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル

融点：１２４～１２５℃

２－ベンジル－３－オキソ－５－（トリフルオロメチル）－２，３－ジヒドロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

メチル

融点：９９～１００℃

[0272] 〔参考例７〕

２－メチル－３－オキソ－５－（トリフルオロメチル）－２，３－ジヒドロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸の合成

２－メチル－３－オキソ－５－（トリフルオロメチル）－２，３－ジヒドロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル３１２ｍｇ（１．１３ｍｍｏｌ）のエタノール３ｍｌ溶液に、水酸化ナトリウム５０ｍｇ（１．２５ｍｍｏｌ）の３ｍｌ水溶液を氷冷下にて添加した。添加終了後、該反応溶液を同温度にて１時間撹拌した。反応終了後、１ｍｏｌ／Ｌ塩酸３ｍｌを加え、ジクロロメタンにて抽出（１０ｍｌ×３回）した。得られた有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄することにより、目的物２５０ｍｇを黄色固体として得た。

融点：１５５～１６０℃

[0273] 同様の方法で以下の化合物を合成した。

２－エチル－３－オキソ－５－（トリフルオロメチル）－２，３－ジヒドロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：１６０～１６３℃

２－イソプロピル－３－オキソ－５－（トリフルオロメチル）－２，３－ジヒドロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：１６０～１６２℃

２－ベンジル－３－オキソ－５－（トリフルオロメチル）－２，３－ジヒドロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

融点：８４～８６℃

[0274] 〔参考例８〕

３－チオキソ－５－（トリフルオロメチル）－２，３－ジヒドロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチルの合成

合成例８の工程１記載の方法で合成した３－チオキソ－５－（トリフルオロメチル）－２，３－ジヒドロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチルとイミダゾールの混合物１００ｍｇを酢酸エチル５０ｍｌに溶かし、１ｍｏｌ／Ｌ塩酸２０ｍｌで洗浄した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて溶媒を留去することで、目的物６３ｍｇを橙黄色固体として得た。

融点：２１８～２２０℃

[0275] ［参考例９］

３－（フェニルアミノ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

工程１；２－（２－（フェニルカルバモイル）ヒドラジニル）－６－（トリフルオロメチル）ニコチン酸メチルの合成

２－ヒドラジニル－６－（トリフルオロメチル）ニコチン酸メチル５００ｍｇ（２．１３ｍｍｏｌ）のテトラヒドロフラン１３ｍｌ溶液に、イソシアン酸フェニル２５５ｍｇ（２．１４ｍｍｏｌ）を氷冷下にて添加した。添加終了後、該反応溶液を同温度にて１４時間撹拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した。得られた固体をジイソプロピルエーテルで洗浄することにより、目的物７４０ｍｇを白色固体として得た。

融点：１９０～１９５℃

[0276] 工程２；３－（フェニルアミノ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチルの合成

２－（２－（フェニルカルバモイル）ヒドラジニル）－６－（トリフルオロメチル）ニコチン酸メチル７３０ｍｇ（２．０６ｍｍｏｌ）及びトルエン１５ｍｌの混合溶液に、室温にて塩化ホスホリル９４０ｍｇ（６．１１ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応混合物を加熱還流下にて３時間撹拌した。撹拌終了後、該反応混合物を室温まで冷却した後、氷水に添加し反応

を停止させ、該反応液を酢酸エチルにて抽出（３０ｍｌ×２回）した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣をｎ－ヘキサン－酢酸エチル－メタノール（９０：１０：０～０：１００：０～０：９０：１０のグラジエント）にて溶出する中圧分取液体クロマトグラフィーにて精製し、目的物４８０ｍｇを黄色固体として得た。

融点：２２５～２３０℃

[0277] 工程３：３－（フェニルアミノ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸の合成

３－（フェニルアミノ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸メチル４７０ｍｇ（１．４０ｍｍｏｌ）及びメタノール１０ｍｌの混合溶液に、氷冷下にて１ｍｏｌ／Ｌの水酸化ナトリウム水溶液８．０ｍｌ（８．０ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応溶液を氷冷下にて３時間撹拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した後、１Ｎ塩酸を添加し、ｐＨを５～６とした。該反応混合液を酢酸エチルにて抽出（３０ｍｌ×２回）し、得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄することにより、目的物２５０ｍｇを橙色固体として得た。

融点：１２５～１３０℃

[0278] ［参考例１０］

３－（（２－メトキシエチル）（メチル）アミノ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸

工程１；２－（２－（（２－メトキシエチル）（メチル）カルバモイル）ヒドラジニル）－６－（トリフルオロメチル）ニコチン酸エチルの合成

３－オキソ－５－（トリフルオロメチル）－２，３－ジヒドロ－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸エチル５００ｍｇ（１．８２ｍｍｏｌ）、Ｎ－（２－メトキシエチル）メチルアミン３２０

ｍｇ（３．５９ｍｍｏｌ）及びテトラヒドロフラン１０ｍｌの混合物を加熱還流下にて３時間撹拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した。得られた残渣をｎ－ヘキサン－酢酸エチル（９０：１０～０：１００のグラジエント）にて溶出する中圧分取液体クロマトグラフィーにて精製し、目的物６１０ｍｇを淡黄色固体として得た。

融点：６５～６６℃

[0279] 工程２；３－（（２－メトキシエチル）（メチル）アミノ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸エチルの合成

２－（２－（（２－メトキシエチル）（メチル）カルバモイル）ヒドラジニル）－６－（トリフルオロメチル）ニコチン酸エチル５９５ｍｇ（１．６３ｍｍｏｌ）及びトルエン１０ｍｌの混合溶液に、室温にて塩化ホスホリル７５０ｍｇ（４．９４ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応混合物を加熱還流下にて１．５時間撹拌した。撹拌終了後、該反応混合物を室温まで冷却した後、氷水に添加し反応を停止させ、炭酸水素ナトリウム水溶液を加えてｐＨを８～９とした後、酢酸エチルにて抽出（３０ｍｌ×２回）した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。得られた残渣をｎ－ヘキサン－酢酸エチル（９０：１０～０：１００のグラジエント）にて溶出する中圧分取液体クロマトグラフィーにて精製し、目的物５２０ｍｇを橙色液体として得た。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ7.91 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.80 (d, 1H, J=7.2Hz), 4.55 (q, 2H, J=6.9Hz), 3.75-3.41 (m, 4H), 3.27 (s, 3H), 2.87 (s, 3H), 1.48 (t, 3H, J=6.9Hz)。

[0280] 工程３；３－（（２－メトキシエチル）（メチル）アミノ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボン酸の合成

３－（（２－メトキシエチル）（メチル）アミノ）－５－（トリフルオロメチル）－［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジン－８－カルボ

ン酸エチル５００ｍｇ（１．４４ｍｍｏｌ）及びエタノール１０ｍｌの混合溶液に、氷冷下にて１ｍｏｌ／Ｌの水酸化ナトリウム水溶液４．５ｍｌ（４．５ｍｍｏｌ）を添加した。添加終了後、該反応溶液を氷冷下にて１時間撹拌した。反応終了後、該反応溶液中の溶媒を減圧下にて留去した後、１ｍｏｌ／Ｌ塩酸を添加し、ｐＨを４とした。該反応混合液を酢酸エチルにて抽出（３０ｍｌ×２回）し、得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて溶媒を留去することにより、目的物４７０ｍｇを淡黄色固体として得た。

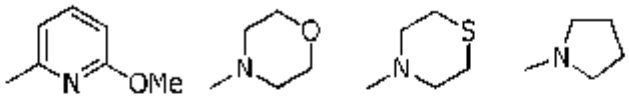
融点：１１５～１２０℃

[0281] 〔参考例１１〕

参考例９又は参考例１０と同様の方法で、第１５表に示す化合物を合成した。尚、表中Ｍｅとの記載はメチル基を表し、以下同様にＥｔはエチル基を、Ｐｈはフェニル基及びｃはシクロを各々意味する。

また、表中Ｄ－９ｂ、Ｄ－１４、Ｄ－１７及びＤ－１９で表される置換基は、以下の構造を表す。

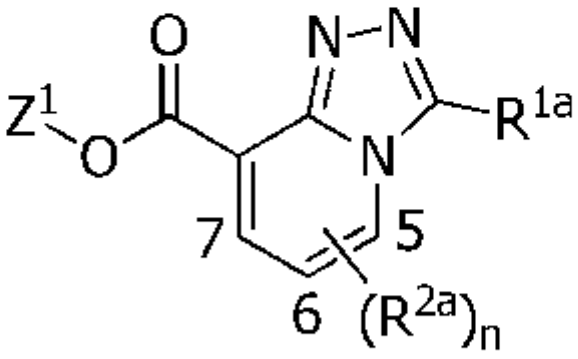
[化57]



D-9b D-14 D-17 D-19

[0282] 〔第１５表〕

[化58]



[表47]

No	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	Z^1	融点(℃)
C2-01	N(Me)Ph	5-CF_3	H	160-170
C2-02	$NHCH(CH_3)_2$	5-CF_3	H	145-146
C2-03	D-14	5-CF_3	H	210-213
C2-04	NH(D-9b)	5-CF_3	H	170-174
C2-05	$NH(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	H	150-155
C2-06	$NHSO_2Ph$	5-CF_3	H	>290
C2-07	D-17	5-CF_3	H	160-165
C2-08	$NH(CH_2)_2SMe$	5-CF_3	H	173-176
C2-09	$NHCH_2CF_3$	5-CF_3	H	180-183
C2-10	$N(Me)CH(CH_3)_2$	5-CF_3	H	135-137
C2-11	N(Me)Hex-c	5-CF_3	H	184-186
C2-12	N(Me)Et	5-CF_3	H	140-141
C2-13	$N(Et)_2$	5-CF_3	H	126-127
C2-14	D-19	5-CF_3	H	150-151
C2-15	$N(Me)CH_2C=CH$	5-CF_3	H	133-134
C2-16	$N(Me)(CH_2)_2CN$	5-CF_3	H	136-137
C2-17	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF_3	H	168-171
C2-18	$N(Me)CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	H	117-118
C2-19	$N(Me)CH_2(4-MeO-Ph)$	5-CF_3	H	105-110

[0283] 〔第１６表〕

[表48]

No.	^{1}H NMR (CDCl$_3$, Me$_4$Si, 300MHz)
A1-01a	δ 10.02 (brs, 1H), 8.34 (d, 1H, J=7.8Hz), 8.26 (s, 1H), 8.23 (brs, 1H), 7.11 (d, 1H, J=7.8Hz), 3.96 (s, 3H)。
A1-04a	δ 10.21 (d, 1H, J=6.0Hz), 8.84 (d, 1H, J=5.7Hz), 8.35 (dd, 1H, J=7.2Hz, 0.9Hz), 7.88-7.85 (m, 2H), 7.56-7.46 (m, 3H), 7.08 (d, 1H, J=7.8Hz), 3.98 (s, 3H)。
A1-08a	δ 9.70 (brs, 1H), 9.26 (brs, 1H), 8.32 (d, 1H, J=7.8Hz), 7.07 (d, 1H, J=7.8Hz), 4.21 (s, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.89-3.86 (m, 2H), 3.65-3.62 (m, 2H), 3.40 (s, 3H)。
B1-01a	δ 9.04 (d, 1H, J=1.8Hz), 8.14 (d, 1H, J=6.6Hz), 7.41 (d, 1H, J=6.6Hz), 4.13 (s, 3H)。
B1-02a	δ 7.95 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.44 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.09 (s, 3H), 2.32-2.25 (m, 1H), 1.38-1.33 (m, 2H), 1.22-1.16 (m, 2H)。
B1-04a	δ 8.04 (dd, 1H, J=7.2Hz, 0.6Hz), 7.60-7.42 (m, 6H), 4.14 (s, 3H)。
B1-08a	δ 8.04 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.49 (d, 1H, J=7.2Hz), 5.21 (d, 2H, J=0.9Hz), 4.11 (s, 3H), 3.76-3.72 (m, 2H), 3.54-3.51 (m, 2H), 3.33 (s, 3H)。
B1-27a	δ 8.04 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.46-7.60 (m, 1H), 7.35-7.45 (m, 2H), 7.00-7.15 (m, 1H), 6.50-7.00 (m, 1H), 4.13 (s, 3H), 3.65 (s, 3H)。
B1-29a	δ 8.49 (s, 1H), 8.00-8.15 (m, 1H), 7.75-7.85 (m, 1H), 7.40-7.60 (m, 2H), 4.13 (s, 3H)。
B1-34a	δ 8.17 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.70 (d, 1H, J=8.1Hz), 7.54 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.35-7.45 (m, 2H), 7.20-7.30 (m, 2H), 4.17 (s, 3H), 3.54 (s, 3H)。
B1-49a	δ 8.00 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.54 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.10 (s, 3H), 2.91 (d, 1H, J=7.5Hz), 1.91 (d, 1H, J=7.5Hz), 1.85 (s, 3H)。
C1-01	δ 9.06 (d, 1H, J=1.8Hz), 8.33 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.57 (d, 1H, J=6.9Hz), (CO$_2$Hのプロトンピークは観測されなかった。)
C1-02	δ 8.38 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.60 (d, 1H, H=7.5Hz), 2.39-2.28 (m, 1H), 1.42-1.35 (m, 2H), 1.29-1.23 (m, 2H)。(CO$_2$Hのプロトンピークは観測されなかった。)
C1-04	δ 8.30 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.60-7.49 (m, 6H)。(CO$_2$Hのプロトンピークは観測されなかった。)

[0284] 試験例

次に、本発明化合物の除草剤としての有用性について、以下の試験例において具体的に説明するが、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

〔試験例１〕湛水条件における雑草発生前処理による除草効果試験

１／１００００アールのワグネルポットに沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深４cmの湛水条件とした。ノビエ、ホタルイ及びコナギの種子を上記カップに混播した後、２．５葉期のイネ苗を移植した。播種当日、配合例２に準じて調製した本発明化合物の乳剤を所定の薬量になるように水で希釈し、水面に処理した。カップを２５乃至３０℃の温室内に置いて植物を育成し、薬剤処理３週間後に、各種植物に対する影響を下記の判定基準に従

い調査した。結果を第１７表に示す。

判定基準

５　…　殺草率　９０％以上　（ほとんど完全枯死）

４　…　殺草率　７０％以上９０％未満

３　…　殺草率　４０％以上７０％未満

２　…　殺草率　２０％以上４０％未満

１　…　殺草率　　５％以上２０％未満

０　…　殺草率　　５％以下　（ほとんど効力なし）

[0285] 〔試験例２〕湛水条件における雑草生育期処理による除草効果試験

１／１００００アールのワグネルポットに沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深４cmの湛水条件とした。ノビエ、ホタルイ及びコナギの種子を上記カップに混播し、２５乃至３０℃の温室内に置いて植物を育成した。ノビエ、ホタルイ及びコナギが１乃至２葉期に達したとき、配合例２に準じて調製した本発明化合物の乳剤を所定の薬量になるように水で希釈し、水面に処理した。薬剤処理３週間後に、各種植物に対する影響を試験例１の判定基準に従って調査した。結果を第１８表に示す。

[0286] 〔試験例３〕茎葉処理による除草効果試験

１／１００００アールのワグネルポットに沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深０．１乃至０．５cmの条件とした。イヌビエ、アゼガヤ、タマガヤツリ及びイネの種子を播種し、２５乃至３０℃の温室内に置いて植物を育成した。１４日間育成したのち、配合例２に準じて調製した本発明化合物の乳剤を所定の薬量になるように水で希釈し、茎葉部へ小型スプレーで均一に処理した。薬剤処理３週間後に、各種植物に対する影響を試験例１の判定基準に従って調査した。結果を第１９表に示す。

[0287] 〔試験例４〕茎葉処理による除草効果試験

縦２１cm、横１３cm、深さ７cmのプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、メヒシバ、エノコログサ、イヌビエ、カラスムギ、ブラックグラス、イタリアンライグラス、セイヨウヌカボ、イチビ、アオゲイトウ、シロザ、

ハコベ、ヤエムグラ、オオイヌノフグリ、トウモロコシ、ダイズ、イネ、コムギ、ビート及びナタネの種子をそれぞれスポット状に播種し、約１．５cm覆土した後、２５乃至３０℃の温室内において植物を育成した。１４日間育成したのち，配合例２に準じて調製した本発明化合物の乳剤を所定の薬量になるように水で希釈し、茎葉部へ小型スプレーで均一に処理した。薬剤処理３週間後に、各種植物に対する影響を試験例１の判定基準に従って調査した。結果を第２０表に示す。

[0288] 尚、第１７表乃至第２０表中の記号は以下の意味を表す。

Ａ：ノビエ、Ｂ：ホタルイ、Ｃ：コナギ、Ｄ：アゼガヤ、Ｅ：タマガヤツリ、Ｆ：メヒシバ、Ｇ：エノコログサ、Ｈ：イヌビエ、Ｉ：カラスムギ、Ｊ：ブラックグラス、Ｋ：イタリアンライグラス、Ｌ：セイヨウヌカボ、Ｍ：イチビ、Ｎ：アオゲイトウ、Ｏ：シロザ、Ｐ：ハコベ、Ｑ：ヤエムグラ、Ｒ：オオイヌノフグリ、ａ：移植イネ、b:直播イネ、ｃ：トウモロコシ、ｄ：ダイズ、ｅ：コムギ、ｆ：ビート、ｇ：ナタネ

また処理薬量（ｇ／ｈａ）とは、１ヘクタール（１ｈａ）当たりに換算したときに、記載した数値のグラム（ｇ）数だけ処理されるように濃度を調整したことを表す。

[0289] 〔第１７表〕

[表49]

No.	処理薬量（g／ha）	A	B	C	a
I-001	320	3	2	2	0
I-002	320	2	1	0	0
I-004	320	5	4	4	1
I-005	320	5	4	4	0
I-010	320	5	3		0
I-011	320	5	4	5	1
I-012	320	5	3	4	0
I-014	320	5	4	3	0
I-015	320	2	3	3	0
I-016	320	4	0	0	0
I-017	320	3	2	0	0
I-018	320	1	3	5	0
I-019	320	5	3	4	2
I-020	320	4	3	2	0
I-021	320	5	4	4	2
I-022	320	2	2	0	0
I-024	320	5	2	0	0
I-026	320	5	4	4	2
I-027	320	5	3	4	1
I-029	320	5	3	4	2
I-030	320	5	3	3	0
I-031	320	4	3	3	0
I-032	320	5	3	2	2
I-033	320	5	4	3	0
I-034	320	4	4	4	3
I-035	320	5	4	4	2
I-036	320	4	3	3	4
I-037	320	0	2	3	0
I-038	320	2	2	1	0
I-040	320	3	3	3	1
I-041	320	3	3	3	0
I-042	320	2	2	2	0
I-043	320	5	3	3	3
I-044	320	5	3	3	1
I-046	320	5	3	3	2
I-047	320	4	3	2	1
I-048	320	3	0	0	1
I-049	320	5	2	0	0
I-050	320	5	5	4	2
I-051	320	5	4	4	0
I-052	320	3	3	2	0
I-053	320	2	3	2	0
I-054	320	5	3	4	2
I-055	320	4	4	4	1
I-056	320	5	5	4	3
I-057	320	5	5	4	2
I-058	320	5	5	4	4

[表50]

No.	処理薬量（g／ha）	A	B	C	a
I-059	320	2	3	2	0
I-060	320	4	4	3	2
I-062	320	3	2	1	0
I-063	320	5	4	3	0
I-064	320	5	4	3	0
I-065	320	5	3	2	0
I-066	320	5	4	2	2
I-067	320	3	0	0	0
I-068	320	2	3	3	0
I-069	320	5	4	3	0
I-070	320	5	5	5	3
I-071	320	4	5	4	0
I-073	320	4	3	2	3
I-074	320	2	2	0	0
I-075	320	2	0	2	0
I-076	320	5	4	4	3
I-077	320	0	0	2	0
I-078	320	4	4	3	4
I-079	320	4	4	3	4
I-080	320	5	4	4	4
I-082	320	3	2	2	0
I-083	320	2	3	3	0
I-084	320	2	3	2	0
I-085	320	3	4	3	3
I-086	320	5	4	4	5
I-087	320	5		3	0
I-090	320	3	4	2	0
I-091	320	5	5	5	0
I-092	320	5	5	4	3
I-093	320	5	4	3	0
I-094	320	5	5	3	0
I-095	320	5	5	5	1
I-096	320	5	4	4	3
I-100	320	4	3	3	0
I-102	320	3	2	2	2
I-103	320	5	4	4	3
I-104	320	4	3	2	0
I-105	320	5	5	4	0
I-106	320	5	5	4	1
I-107	320	5	4	5	2
I-108	320	5	5	5	0
I-109	320	0	2	0	0
I-110	320	5	4	4	4
I-112	320	3	3	2	0
I-113	320	4	3	2	0
I-114	320	3	2	0	0
I-115	320	5	4	3	0

[表51]

No.	処理薬量 (g/ha)	A	B	C	a
1-116	320	5	4	2	0
1-118	320	3	2	0	2
1-119	320	2	1	0	3
1-120	320	5	3	1	3
1-121	320	5	4	4	3
1-122	320	5	5	5	3
1-123	320	5	4	4	-
1-124	320	3	3	1	0
1-125	320	0	3	1	0
1-126	320	3	4	2	0
1-128	288	5	4	2	0
1-129	320	5	4	3	-
1-130	320	1	0	0	-
1-131	320	2	1	0	0
1-132	320	5	4	4	2
1-133	320	5	3	4	0
1-134	320	3	3	2	0
1-135	320	3	4	4	-
1-136	320	5	3	3	-
1-137	320	5	5	5	3
1-138	320	5	5	4	2
1-139	320	5	4	3	2
1-143	320	0	0	2	0
1-144	320	5	3	3	-
1-145	320	5	5	5	4
1-146	320	5	5	5	3
1-147	320	5	5	5	2
1-148	320	5	5	5	4
1-149	320	5	4	3	3
1-150	320	5	5	5	4
1-151	320	5	5	3	0
1-152	320	5	4	3	2
1-153	320	3	3	4	2
1-154	320		3	2	0
1-155	320		4	3	0
1-156	320		2	0	0
1-157	320		3	2	2
1-158	320		4	0	0
1-159	320		3	0	0
1-161	320		2	0	0
1-162	320		2	0	0
1-163	320		4	4	2
1-164	320		5	4	3
1-165	320	4	3	4	0
1-166	320		3	2	0
1-167	320	4	2	0	0
1-169	320	5	4	4	0

[表52]

No.	処理薬量 (g/ha)	A	B	C	a
1-171	320	5	4	4	1
1-172	320	5	4	3	1
2-001	320	2	3	4	0
2-002	320	2	3	3	0
2-003	320	5	5	5	4
2-005	320	5	5	5	0
2-006	320	5	5	5	4
2-007	320	5	5	5	3
2-008	320	4	4	4	1
2-009	320	3	3	4	0
2-010	320	5	5	4	4
2-011	320	5	5	5	2
2-012	320	5	4	3	1
2-013	320	5	4	5	3
2-014	320	5	5	5	4
2-015	320	5	5	5	1
2-016	320	5	5	5	4
2-017	320	5	3	4	4
2-019	320	5	5	4	2
2-020	320	3	2	2	1
2-021	320	5	5	5	4
2-022	320	5	5	5	5
2-023	320	2	1	0	3
2-024	320	5	5	5	5
2-025	320	5	5	5	5
2-026	320	5	5	4	4
2-027	320	5	5	5	4
2-028	320	5	5	5	5
2-029	320	5	5	5	5
2-030	320	5	4	4	3
2-031	320	5	5	5	5
2-032	320	5	5	5	5
2-033	320	5	4	5	4
2-034	320	5	4	4	4
2-035	320	4	3	3	4
2-037	320	5	5	5	4
2-038	320	5	5	5	4
2-039	320	5	5	5	4
2-040	320	4	4	4	4
2-041	320	5	5	4	0
2-042	320	5	4	4	5
2-043	320	5	5	5	4
2-044	320	5	5	5	4
2-045	320	5	5	5	5
2-046	320	4	0	0	0
2-047	320	5	4	5	4
2-048	320	5	5	4	4

[表53]

No.	処理薬量 (g/ha)	A	B	C	a
2-049	320	5	5	4	3
2-050	192	4	2	3	2
2-051	320	5	5	5	4
2-052	320	5	5	5	5
2-053	320	5	5	4	5
2-054	320	5	5	5	5
2-055	320	4	4	3	1
2-057	320	4	4	4	4
2-058	320	4	4	5	5
2-059	320	4	4	4	5
2-060	320	5	5	5	5
2-061	320	5	5	5	4
2-062	320	5	5	5	5
2-063	320	5		5	4
2-064	320	5		2	3
2-065	320	5	4	4	2
2-066	320	5	5	4	3
2-067	320	5	4	4	5
2-068	320	5	5	4	5
2-069	320	5	5	5	5
2-070	320	5	5	5	4
2-071	320	5	5	5	4
2-072	320	5	5	5	3
2-073	320	4	3	4	2
2-074	320	4	4	3	3
2-075	320	5	5	5	5
2-076	320	5	4	3	2
2-077	320	5	3	3	1
2-078	320	5	4	2	4
2-079	320	5	5	5	4
2-080	320	3	0	0	2
2-081	320	4	3	4	3
2-082	320	5	5	5	5
2-083	320	5	5	4	2
2-084	320	5	5	4	4
2-085	320	5	5	4	1
2-086	320	3	2	3	0
2-087	320	5	5	4	3
2-088	141	5	5	5	3
2-089	320	5	5	5	4
2-090	320	5	5	5	4
2-091	320	5	5	5	0
2-093	320	5	5	4	2
2-094	320	5	5	5	4
2-095	320	5	5	5	5
2-096	320		5	4	3
2-097	320		4	3	1

[表54]

No.	処理薬量 (g／ha)	A	B	C	a
2-098	320		5	4	2
2-099	320	5	4	5	4
2-100	320	5	5	5	3
2-101	320	5	5	5	3
2-102	320	5	5	4	1
2-103	320	5	4	5	3
2-105	320	5	5	5	4
2-106	320	5	3	4	2
2-107	320	2	3	2	1
2-108	320	4	3	2	0
2-109	260	2	3		0
2-110	320	5	5	5	4
4-003	320		2	0	0
6-002	320	4	3	2	0
6-004	320	0	0	2	0
7-001	320	0	2	4	0
7-002	320	3	3	4	1

[0290] 〔第１８表〕

[表55]

No.	処理薬量（g／ha）	A	B	C
I-001	320	4	4	2
I-002	320	3	0	C
I-004	320	4	3	4
I-005	320	5	1	C
I-010	320	4	1	4
I-011	320	5	3	3
I-012	320	2	2	2
I-014	280	2	3	C
I-015	320	4	2	1
I-016	320	3	0	C
I-017	320	2	2	C
I-018	320	0	2	C
I-019	320	4	3	3
I-020	320	2	2	2
I-021	320	4	4	3
I-022	320	2	2	C
I-024	320	4	1	C
I-026	320	3	1	C
I-027	320	4	3	3
I-029	320	3	2	3
I-030	320	4	3	3
I-031	320	3	2	2
I-032	320	4	3	3
I-033	320	4	4	3
I-034	320	4	3	4
I-035	320	5	4	4
I-036	320	3	2	4
I-037	320	2	2	
I-038	320	1	1	C
I-040	320	3	2	
I-041	320	2	3	
I-042	320	1	2	3
I-043	320	3	3	3
I-044	320	2	3	2
I-046	320	4		
I-047	320	3	2	3
I-048	320	0	1	C
I-049	320	4	2	2
I-050	320	5	4	3
I-051	320	4	3	4
I-052	320	1	1	C
I-053	320	1	2	C
I-054	320	4	3	3
I-055	320	3	3	3
I-056	320	5	4	4
I-057	320	2	3	3
I-058	320	4	5	4

[表56]

No.	処理薬量 (g／ha)	A	B	C
I-059	320	2	3	2
I-060	320	2	3	2
I-061	320	0	1	1
I-062	320	2	2	2
I-063	320	4	3	2
I-064	320	2	3	2
I-065	320	1	2	2
I-066	320	2	3	2
I-068	320	2	2	2
I-069	320	4	4	4
I-070	320	5	5	5
I-071	320	3	5	4
I-073	320	2	2	1
I-074	320	2	0	0
I-076	320	2	0	4
I-078	320	4	3	3
I-079	320	4	3	4
I-080	320	5	3	4
I-083	320	2	2	2
I-084	320	2	1	0
I-085	320	3	2	2
I-086	320	4	4	4
I-087	320	4		3
I-090	320	2	1	3
I-091	320	5	5	5
I-092	320	4	4	3
I-093	320	3	3	3
I-094	320	4	3	3
I-095	320	4	5	4
I-096	320	4	3	4
I-100	320	4	3	4
I-102	320	1	1	1
I-103	320	4	5	4
I-104	320	4	3	3
I-105	320	3	4	3
I-106	320	5	5	4
I-107	320	5	4	4
I-108	320	4	4	3
I-109	320	0	1	0
I-110	320	4	3	4
I-112	320	1	2	0
I-113	320	2	0	0
I-114	320	0	1	0
I-115	320	3	3	
I-116	320	3	4	0
I-118	320	2	3	0
I-119	320	4	1	0

[表57]

No.	処理薬量（g／ha）	A	B	C
I-120	320	3	3	2
I-121	320	4	4	4
I-122	320	4	3	3
I-123	320	3	2	3
I-124	320	3	3	1
I-125	320	0	2	1
I-126	320	1	3	3
I-128	288	1	3	0
I-129	320	3	4	3
I-131	320	0	1	0
I-132	320	4	4	4
I-133	320	2	2	3
I-134	320	1	3	3
I-135	320	2	2	3
I-136	320	0	2	2
I-137	320	3	3	3
I-138	320	3	3	3
I-139	320	4	3	3
I-144	320	4	4	3
I-145	320	4	4	4
I-146	320	3	3	3
I-147	320	4	2	3
I-148	320	5	5	4
I-149	320	3	3	2
I-150	320	5	5	4
I-151	320	4	4	2
I-152	320	3	3	3
I-153	320	3	3	3
I-154	320	0	2	0
I-155	320	1	2	0
I-156	320	0	3	2
I-157	320	0	1	0
I-158	320	2	3	0
I-159	320	3		
I-162	320	3	1	0
I-163	320	4		
I-164	320	4	4	4
I-165	320	2	2	
I-166	320	2	3	
I-168	320	2	2	
I-169	320	3	4	4
I-171	320	4		
I-172	320	3	4	3
I-173	320	3	2	2
2-001	320	2	2	3
2-002	320	2	1	2
2-003	320	5	3	4

[表58]

No.	処理薬量（g／ha）	A	B	C
2-005	320	5	3	4
2-006	320	5	5	5
2-007	320	4	4	4
2-008	320	3	2	3
2-009	320	3	2	3
2-010	320	5	4	4
2-011	320	4	3	4
2-012	320	4	5	5
2-013	320	5	3	2
2-014	320	5	5	5
2-015	320	4	5	4
2-016	320	5	5	5
2-017	320	5	4	4
2-019	320	4	3	4
2-020	320	2	2	0
2-021	320	5	4	4
2-022	320	5	5	4
2-023	320	0	1	1
2-024	320	5	4	4
2-025	320	5	4	5
2-026	320	5	5	4
2-027	320	5	4	4
2-028	320	5	4	4
2-029	320	5	4	4
2-030	320	4	3	4
2-031	320	5	4	4
2-032	320	5	5	5
2-033	320	4	3	4
2-034	320	5	4	4
2-035	320	2	2	3
2-037	320	5	5	5
2-038	320	5	4	5
2-039	320	5	5	5
2-040	320	4	3	4
2-041	320	5	4	3
2-042	320	4	3	4
2-043	320	5	4	4
2-044	320	5	4	4
2-045	320	5	3	4
2-047	320	3	5	4
2-048	320	3	4	3
2-049	320	5	5	4
2-050	192	1	0	2
2-051	320	5	5	5
2-052	320	5	4	4
2-053	320	5	4	4
2-054	320	5	4	5

[表59]

No.	処理薬量（g／ha）	A	B	C
2-056	320	3	3	3
2-057	320	4	4	4
2-058	320	4	4	4
2-059	320	4	3	4
2-060	320	5	3	5
2-061	320	4	5	5
2-062	320	5	4	5
2-060	320	5	4	5
2-061	320	4	5	5
2-062	320	5	4	5
2-063	320	5	4	5
2-064	320	3	4	3
2-065	320	5	4	4
2-066	320	3		3
2-067	320	5	4	5
2-068	320	5	5	4
2-069	320	5	5	5
2-070	320	5	5	5
2-071	320	3	5	5
2-072	320	5	5	5
2-073	320	2	2	3
2-074	320	4	4	3
2-075	320	5	5	5
2-076	320	2	3	2
2-077	320	2	2	2
2-078	320	4	4	3
2-079	320	5	5	5
2-080	320	2	1	0
2-081	320	2	2	2
2-082	320	5	4	3
2-083	320	3	3	3
2-084	320	4	4	3
2-085	320	4	4	3
2-086	320	0	2	1
2-087	320	4	4	3
2-088	141	4	3	4
2-089	320	4	4	5
2-090	320	5	5	4
2-091	320	4	5	4
2-093	320	2	4	3
2-094	320	5	5	4
2-095	320	4	5	5
2-096	320	3	3	3
2-097	320	0	2	2
2-098	320	5	4	3
2-099	320	5	5	4
2-100	320	4	3	4

[表60]

No.	処理薬量 (g/ha)	A	B	C
2-101	320	4	4	5
2-102	320	4	4	4
2-103	320	4	3	4
2-105	320	4	4	4
2-106	320	1	2	3
2-107	320	2	1	2
2-108	320	0	1	
2-109	260	1	1	
2-110	320	5	5	4
3-002	320	3	2	3
5-004	320	3	0	2
7-002	320	4	2	2

[0291] 〔第19表〕

[表61]

No.	処理薬量（g／ha）	H	D	E	b
I-001	320	5	5	4	C
I-002	400	4	4		C
I-004	400	4	5	5	C
I-005	400	2	5	5	C
I-008	320	3	0		C
I-010	400	5	5	4	C
I-011	400	5	5	5	C
I-012	400	3	5		C
I-013	320	3	4	3	C
I-014	320	5	2	1	1
I-015	320	5	5	4	1
I-016	320	5	5	5	1
I-017	320	4	3	4	C
I-018	320	4	4	4	2
I-019	320	5	5	5	4
I-020	320	5	4	4	2
I-021	320	5	5	5	3
I-022	320	5	5	4	2
I-024	320	5	4	4	2
I-025	320	4	3	2	2
I-026	320	5	1	1	1
I-027	320	5	5	5	3
I-029	320	4	5	4	4
I-030	320	5	5	5	4
I-031	320	5	4	3	2
I-032	320	5	5	5	2
I-033	320	5	5	5	1
I-034	320	5	5	5	5
I-035	320	5	5	5	4
I-036	320	5	5	5	4
I-037	320	5	5	5	2
I-038	320	5	5	1	2
I-039	320	3	3	3	2
I-040	320	4	5	4	3
I-041	320	4	5	5	2
I-042	320	5		4	1
I-043	320	5	4	5	5
I-044	320	5	4	4	3
I-045	320	1	3	4	C
I-046	320	5	3	3	3
I-047	320	5	5	4	3
I-048	320	5	4	3	C
I-049	320	5	1	1	1
I-050	320	5	5	5	1
I-051	320	4	5	4	C
I-052	320	4	5	5	C
I-053	320	4	4	4	C

[表62]

No.	処理薬量 (g/ha)	H	D	E	b
I-054	320	5	5	5	3
I-055	320	5	4	5	2
I-056	320	5	5	5	4
I-057	320	5	5	5	3
I-058	320	5	5	5	4
I-059	320	0	3	3	0
I-060	320	5	4	3	2
I-061	320	5	4	3	1
I-062	320	5	4	4	2
I-063	320	5	5	5	2
I-064	320	5	4	4	2
I-065	320	3	1	3	0
I-066	320	1	4	3	0
I-067	320	5	5	5	2
I-068	320	5	5	5	1
I-069	320	5	5	5	1
I-070	320	4	5	5	0
I-071	320	0	3	5	0
I-072	320	2	1	0	0
I-073	320	5	5	5	4
I-074	320	5	4	3	0
I-075	320	5	4	4	1
I-076	320	5	5	5	3
I-077	320	5	4	3	0
I-078	320	5	5	5	5
I-079	320	5	5	5	5
I-080	320	5	5	5	5
I-081	320	2	0	0	0
I-082	320	4	4	4	0
I-083	320	5	5	5	2
I-084	320	5	5	5	2
I-085	320	5	5	5	3
I-086	320	5	5	5	0
I-087	320	5	5	5	1
I-089	224	3	3	2	0
I-090	320	5	5	5	0
I-091	320	5	5	5	0
I-092	320	5	5	5	4
I-093	320	4	5	4	1
I-094	320	5	4	4	1
I-095	320	4	4	4	1
I-096	320	5	5	4	4
I-100	320	5	5	4	0
I-101	320	1	0	0	0
I-102	320	4	5	4	2
I-103	320	5	5	5	4
I-104	320	5	5	4	0

[表63]

No.	処理薬量（g／ha）	H	D	E	b
1-105	320	5	5	5	0
1-106	320	5	5	5	3
1-107	320	5	5	5	3
1-108	320	5	5	5	1
1-109	320	5	5	3	2
1-110	320	5	5	5	5
1-112	320	2	2	-	0
1-113	320	4	3	3	0
1-114	320	4	4	2	0
1-115	320	5	4	4	0
1-116	320	4	4	0	0
1-117	320	4	4	2	0
1-118	320	5	5	3	3
1-119	320	5	5	2	3
1-120	320	5	5	5	3
1-121	320	5	5	5	3
1-122	320	5	5	5	3
1-123	320	4	4	4	1
1-124	320	4	4	4	0
1-125	320	5	4	3	1
1-126	320	4	4	4	0
1-127	320	4	4	3	0
1-128	286	4	3	3	0
1-129	320	5	5	4	3
1-130	320	5	4	2	2
1-131	320	4	4	3	2
1-132	320	5	5	4	3
1-133	320	4	2	0	0
1-134	320	5	4	2	2
1-135	320	5	4	2	1
1-136	320	4	4	0	2
1-137	320	5	5	4	3
1-138	320	5	5	4	3
1-139	320	4	5	5	1
1-141	320	4	2	3	1
1-142	320	3	1	0	0
1-143	320	4	2	4	0
1-144	320	5	4	2	
1-145	320	5	5	5	
1-146	320	5	5	4	
1-147	320	5	5	3	
1-148	320	5	5	5	
1-149	320	5	5	5	
1-150	320	5	5	5	
1-151	320	5	4	4	
1-152	320	5	5	4	
1-153	320	5	5	3	

[表64]

No.	処理薬量（g／ha）	H	D	E	b
1-154	320	3	2	4	
1-155	320	1	2	5	
1-156	320	3	2	2	
1-157	320	4	3	4	
1-158	320	5	4	4	
1-159	320	5	3	0	
1-162	320	4	4	2	
1-163	320	5	5	4	
1-164	320	5	5	4	
1-165	320	5	4		0
1-166	320	4	3		2
1-167	320	1	2		
1-168	320	4	3		3
1-169	320	5	4		1
1-170	320	2	4		1
1-171	320	4	4		0
1-172	320	5	5		3
1-173	320	5	4		2
1-174	320	2	2		0
2-001	320	4	4	3	1
2-002	320	5	4	2	2
2-003	200	5	5	5	0
2-005	320	5	5	4	2
2-006	320	5	5	5	5
2-007	320	5	5	5	4
2-008	320	4	5	4	0
2-009	320	5	4	3	4
2-010	320	5	5	5	5
2-011	320	5	5	5	5
2-012	320	4	5	5	2
2-013	320	5	5	5	5
2-014	320	5	5	5	5
2-015	320	5	5	5	4
2-016	320	5	5	5	5
2-017	320	5	5	5	5
2-019	320	5	5	5	5
2-020	320	4	4	4	4
2-021	320	5	5	5	5
2-022	320	5	5	5	5
2-023	320	4	1	0	1
2-024	320	5	5	5	5
2-025	320	5	5	5	5
2-026	320	5	5	5	5
2-027	320	5	5	5	5
2-028	320	5	5	5	5
2-029	320	5	5	5	5
2-030	320	4	5	4	5

[表65]

No.	処理薬量 (g/ha)	H	D	E	b
2-037	320	5	5	5	5
2-038	320	5	5	5	5
2-039	320	5	5	5	5
2-040	320	5	5	5	5
2-041	320	5	5	5	5
2-042	320	5	5	5	5
2-043	320	5	5	5	5
2-044	320	5	5	5	5
2-045	320	5	5	5	5
2-046	320	2	3	3	0
2-047	320	4	5	5	3
2-048	320	5	5	5	3
2-049	320	5	5	5	5
2-050	192	4	3	3	0
2-051	320	5	5	5	4
2-052	320	5	5	5	5
2-053	320	5	5	5	5
2-054	320	5	5	5	5
2-055	10	2	0	0	0
2-056	320	4	5	4	4
2-057	320	5	5	5	5
2-058	320	5	5	5	5
2-059	320	5	5	5	5
2-060	320	5	5	5	5
2-061	320	5	5	5	5
2-062	320	5	5	5	5
2-063	320	5	5	5	3
2-064	320	1	4	5	0
2-065	320	5	5	5	3
2-066	320	5	5	5	3
2-067	320	5	5	5	5
2-068	320	5	5	5	5
2-069	320	5	5	5	5
2-070	320	5	5	5	3
2-071	320	4	5	5	3
2-072	320	4	5	5	5
2-073	320	4	3	5	2
2-074	320	5	5	4	5
2-075	320	5	5	5	5
2-076	320	5	4	4	5
2-077	320	2	4	3	0

[表66]

No.	処理薬量（g／ha）	H	D	E	b
2-078	320	5	5	3	4
2-079	320	5	5	5	5
2-080	320	4	5	5	3
2-081	320	5	5	5	4
2-082	320	5	5	5	5
2-083	320	4	4	5	0
2-084	320	5	5	5	5
2 085	320	5	5	4	4
2-086	320	5	5	4	3
2-087	320	5	5	5	3
2-088	141	5	5	4	3
2-089	320	4	5	4	2
2 090	320	5	4	5	
2-091	320	5	3	4	
2-092	320	2	3	2	
2-093	320	1	2	5	
2-094	320	5	5	5	
2-095	320	5	5	5	
2-096	320	0	0	5	
2-097	320	2	3	4	
2-098	320	5	5	5	
2-099	320	5	5		4
2-100	320	5	5		3
2-101	320	5	5		4
2-102	320	5	4		1
2-103	320	5	5		1
2-105	320	5	4		5
2-106	320	1	2		0
2-107	320	4	5		4
2-108	320	4	5		4
2-109	260	3	5		2
2-110	320	5	5		3
3-002	320	0	3		0
4-002	320	0	4	0	0
4-003	320	4	3	0	
5-001	320	1	0	0	0
6-002	320	5	5	4	0
6-003	320	1	5	0	0
6-004	320	4	5	2	3
7-001	320	1	2		
7 002	320	4	4	4	0

[0292] 〔第２０表〕

[表67]

No.	処理薬量（g／ha）	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
I-001	320	4	3	4	1	*	1	*	3	3	5	4	4	4	C	0	3	1	4	4
I-002	320	4	2	5	3	*	2	*	3	3	5	5	4		0	0	3	1	5	4
1-004	320	5	4	5	2	2	2	3	4	4	5	5	1	4	C	4	4	2	4	3
1 005	320	3	3	4	1	C	0	0	4	3	5	1	0	3	C	1	0	0	0	0
1-008	320	3	1	5	0	0	0	0	0	2	3	0	0	0	C	0	0	0	0	0
I-01C	320	3	3	4	3	2	1	2	5	5	5	5	1	5	0	1	4	1	5	3
1-011	320	5	4	5	1	1	1	2	5	5	5	5	2	5	0	3	4	0	5	3
1-012	320	3	4	4	0	C	1	*	3	3	5	4	2	4	0	1	2	0	3	4
1-013	320	3	1	4	0	*	1	0	3	3	5	4	1	3	C	0	0	1	3	0
1-014	320	3	3	4	1	*	1	0	4	5	5	5	3	4	1	0	3	1	5	2
1 015	320	4	3	5	3	*	1	3	5	5	5	5	3	5	C	1	4	2	5	4
1-016	320	4	2	5	1	*	1	0	5	5	5	5	2	4	C	0	0	0	5	3
I 017	320	3	0	5	0	0	0	0	5	5	5	4	0	4	C	0	3	0	5	3
1 018	320	C	2	1	0	0	0	0	3	4	5	4	0	4	C	0	0	0	*	0
I-019	320	5	4	5	3	2	2	4	4	5	5	5	4	4	2	2	4	3	5	4
1-02C	320	4	3	5	1	*	1	*	2	4	5	4	3	3	C	1	0	1	5	3
I-021	320	4	3	4	1	*	1	*	5	5	5	5	3	4	1	0	3	1	5	3
1-022	320	4	3	5	1	*	1	*	5	5	5	4	2	4	C	2	3	1	4	2
1-024	320	4	3	4	1	0	0	*	4	5	5	4	3	4	C	2	4	0	4	4
1 025	320	3	2	4	0	0	0	0	5	3	5	4	3	3	C	0	3	0	5	2
1-026	320	3	3	3	1	*	1	2	3	4	5	5	2	5	C	0	3	1	5	3
I-027	320	5	4	5	2	2	1	3	5	5	5	5	3	5	C	1	5	2	5	4
1-029	320	5	4	5	1	*	1	*	5	5	5	5	0	5	3	1	3	1	5	1
1 03C	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	4	3	2	5	3	5	4
1-031	320	4	4	5	2	*	1	*	5	4	5	4	3	4	C	1	3	1	3	3
I-032	320	5	5	5	2	*	1	2	5	5	5	5	2	4	C	0	4	1	5	4
1 033	320	5	5	5	2	*	1	2	5	5	5	5	3	5	C	2	3	1	5	4
I-034	320	5	5	5	3	*	3	3	5	5	5	5	3	5	5	1	4	2	5	4
I-035	320	5	5	5	2	2	2	3	5	5	5	5	2	5	4	3	4	2	5	3
1-036	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	3	3	4	3	5	5
I 037	320	5	4	4	3	2	2	3	5	5	5	4	4	5	C	1	3	3	5	4
1-038	320	5	5	5	3	*	1	2	5	5	5	5	3	5	C	0	4	1	5	4
1 039	320	2	0	4	0	0	0	0	0	1	4	0	0	0	C	0	0	0	2	0
1-04C	320	5	4	4	3	3	3	4	5	5	5	5	3	5	C	0	1	3	5	1
1-041	320	5	4	5	3	*	2	4	5	5	5	5	3	4	C	0	2	3	5	0
1 042	320	4	3	5	2	0	0	2	4	4	5	4	3	4	C	1	3	0	5	3
1-043	320	4	3	5	2	*	1	*	5	5	5	4	3	4	4	2	2	0	5	3
1 044	320	4	4	5	1	*	2	4	5	5	5	4	3	5	C	0	3	0	5	4
1-045	320	3	1	2	0	0	0	0	4	4	5	2	2	3	C	0	1	0	3	3
I 046	320	5	5	5	1	0	0	*	5	5	5	4	2	4	1	2	3	0	5	4
1-047	320	4	4	5	1	0	0	*	5	5	5	4	2	4	C	1	3	0	5	4
I 048	320	5	3	5	2	*	1	2	5	4	5	4	3	4	C	0	4	1	5	4
1-049	320	5	4	5	0	2	2	3	5	5	5	4	3	4	C	4	3	1	5	4
I-05C	320	5	4	5	3	2	3	3	5	5	5	5	2	5	1	3	4	3	5	5
1-051	320	3	3	4	1	0	1	*	5	3	5	3	2	3	C	0	1	1	3	1
1-052	320	3	1	2	0	*	1	3	4	4	5	2	1	3	C	0	2	0	3	3
1 053	320	3	2	3	1	0	0	0	4	4	5	2	2	4	C	0	3	0	3	1

[表68]

No.	処理薬量（g／ha）	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
I-054	320	5	4	5	3	3	3	3	5	5	5	4	4	5	0	1	3	3	4	4
I-055	320	4	3	4	1	3	2	3	5	5	5	5	2	4	0	0	3	1	5	4
I-056	320	5	5	5	3	2	2	3	5	5	5	5	4	5	4	4	4	1	5	5
I-057	320	4	4	4	3	2	2	2	5	5	5	5	1	5	0	1	3	0	5	3
I-058	320	5	5	5	3	3	3	2	5	5	5	5	2	5	5	4	4	1	5	4
I-059	320	0	0	2	0	0	0	0	4	2	5	2	0	2	0	0	0	0	0	0
I-060	320	5	3	5	3	2	2	1	4	4	5	4	3	5	3	0	4	3	5	4
I-061	320	3	3	4	3	1	1	1	5	5	5	4	4	5	1	1	4	0	4	4
I-062	320	5	3	5	3	1	0	1	5	4	5	4	4	4	3	0	3	2	4	4
I-063	320	5	5	5	2	2	2	3	4	4	5	4	3	5	0	3	4	2	5	3
I-064	320	5	4	5	1	1	1	1	3	4			3	3	0	0	3	0	4	3
I-065	320	4	1	1	1	0	0	0	3	3	5	4	0	3	0	0	3	0	4	2
I-066	320	3	1	4	1	0	0	0	3	1	5	4	1	4	0	0	3	0	4	0
I-067	320	5	4	5	1	0	0	0	4	1	5	4	3	4	2	0	3	0	4	4
I-068	320	5	4	5	1	1	1	1	3	3	5	4	3	4	2	0	3	1	4	4
I-069	320	5	5	5	2	2	2	4	3	3	5		3		0	1	3	1	5	3
I-070	320	4	4	5	1	0	0	0	4	4	5	5	3		0	0	4	0	4	3
I-071	320	1	0	0	0	0	0	0	3	2	5		1	3	0	0	0	0	2	0
I-072	320	0	0	0	0	0	0	0	1	0	4	2	0	1	0	0	0	0	0	0
I-073	320	5	5	5	3	2	3	3	5	5	5	5	2		5	0	4	3	5	3
I-074	320	4	4	5	1	0	0	0		4	5	4	3	3	0	0	0	0	4	0
I-075	320	3	1	3	0	0	0	0	1	2	5	3	0	3	0	0	0	0	1	1
I-076	320	5	5	5	3	3	3	4	4	4	5	5	2	4	0	3	3	3	5	4
I-077	320	4	2	4	0	0	0	0	2	3	5	4	1	3	0	0	3	0	3	3
I-078	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	4			4	4	4	4	5	4
I-079	320	5	5	5	4	2	3		5	5	5	5	4		4	1	5	4	5	5
I-080	320	5	5	5	4	5	4	5	5	5	5		5		4	4	5	5	5	5
I-081	320	0	0	0	0	0	0	0	0	0	4	2		0	0	0	0	0	1	0
I-082	320	4	3	4	0	0	1	1	4	3	5		0	4	0	0	3	0		0
I-083	320	5	5	5	3	0	1	0	5	5	5	4	4	4	1	1	4	1	5	4
I-084	320	5	5	5	3	0	0	0	5	5	5	4	4	5	3	1	4	0	4	4
I-085	320	5	5	5		3	3	3	5	5	5	4	4	5	3	3	4	3	4	4
I-086	320	5	4	5	0	0	0	0	5	4	5	5	1	4	1	1	1	0	5	4
I-087	320	5	5	5	3	3	1	2	5	5	5	4	1	4	0	4	4	2	5	4
I-088	320	0	0	0	0	0	0	0	0	1	2	0	0	0	0	0	0	0	0	0
I-089	224	1	0	3	2	0	0	0	2	1	4	4	0	3	0	0	1	0	3	1
I-090	320	5	3	5	3	1	1	1	3		5	4	1	5	0	1	4	0	5	4
I-091	320	5	5	5	4	2	3	3	5	5	5	5	4	5	0	2	4	3	5	5
I-092	320	5	5	5	2	1	1	1	4	4	5	5	3	5	5	1	4	0	5	3
I-093	320	5	3	5	1	0	1	1	4	4	5	4	1	4	0	4	3	0	5	3
I-094	320	5	4	5	2	1	1	1	4	4	5	5	0	4	0	4	3	1	5	3
I-095	320	5	3	5	1	1	2	1	4	4	5	5	3	5	0	2	3	1	5	3
I-096	320	5	5	5	2	1	2	3	4	5	5	4	4	5	4	4	4	1	5	5
I-100	320	3	1	4	1	0	0	0	3	1	5	3	0	1	0	0	1	0	3	0
I-102	320	3	3	4	0	0	0	0	3	4	5	4	2	4	0	0	1	0	4	2
I-103	320	5	5	5	4	2	3	3	4	5	5	5	4	5	1	2	4	3	5	5
I-104	320	5	5	5	4	1	1	2	4	4	5	5	3	4	0	3	4	2	4	4

[表69]

No.	処理薬量（g／ha）	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
I-105	320	4	I	4	I	[illegible]	I	[illegible]	3	3	5	4	1	3	0	I	2	I	4	3
I-106	320	5	5	5	4	[illegible]	3	3	4	5	5	5	4	5	3	1	3	3	5	4
I-107	320	5	5	5	4	3	3	3	4	5	5	5	4	5	4	1	5	3	5	5
I-108	320	5	5	5	2	[illegible]	2	2	4	5	5	5	3	5	1	1	4	1	5	3
I-109	320	4	3	5	1	0	0	0	4	4	5	4	2	4	0	1	3	0	4	4
I-110	320	5	5	5	4	3	3	3	4	5	5	5	4	5	4	4	4	3	5	5
I-112	320	I	0	2	0	0	0	0	3	4	5	4	0	5	0	0	3	0	5	3
I-113	320	I	0	2	0	0	0	0	I	3	5	4	0	3	0	0	0	0	3	0
I-114	320	1	0	3	0	0	0	0	2	3	5	4	1	3	0	0	0	0	4	0
I-115	320	5	5	5	2	2	I	2	3	4	5	4	3	4	0	0	2	2	5	I
I-116	320	5	4	5	3	[illegible]	1	[illegible]	4	4	5	5	3	4	0	0	3	2	5	4
I-117	320	I	I	4	0	0	0	0	3	3	5	3	1	3	0	0	3	0	3	I
I-118	320	5	5	5	3	[illegible]	1	3	4	4	5	4	4	5	4	0	4	1	5	5
I-119	320	5	4	5	3	3	2	3	5	5	5	4	4	5	3	2	4	3	5	5
I-120	320	5	5	5	3	3	3	5	4	5	5	5	5	5	2	0	4	3	5	5
I-121	320	5	4	5	3	3	3	3	4	5	5	5	3	5	2	2	4	3	5	5
I-122	320	5	5	5	2	3	3	4	5	5	5	5	4	5		2	5	2	5	5
I-123	320	4	3	4	1	0	0	0	4	4	5	4	2	3		0	3	0	4	3
I-124	320	5	3	5	2	0	0	[illegible]	5	4	5	3	2	2		1	3	0	3	0
I-125	320	4	1	4	1	0	0	0	3	3	5	4	0	0		2	3	1	5	3
I-126	320	4	3	5	0	0	0	[illegible]	3	3	5	5	1	4		1	2	0	5	3
I-127	320	1	1	4	0	0	0	0	2	1	5	3	0	1		0	1	0	2	0
I-128	288	5	2	5	0	[illegible]	I	[illegible]	3	3	5	5	1	5		0	3	I	5	3
I-129	320	4	4	5	2	[illegible]	1	[illegible]	3	4	5	5	0			2	4	1	5	3
I-130	320	4	4	5	1	[illegible]	1	[illegible]	3	3	5	3	4	3		0	3	0	5	4
I-131	320	4	3	4	0	0	0	0	3	3	5	3	0	3		0	3	0	3	0
I-132	320	4	3	5	1	[illegible]	1	2	4	3	5		2	4		2	3	1	5	4
I-133	320	3	0	4	0	0	0	0	3	3	4	4	1	2		0	3	0	3	0
I-134	320	4	3	5	0	[illegible]	1	[illegible]	4	3	5	4	3	4		0	3	1	5	4
I-135	320	4	3	4	1	[illegible]	1	[illegible]	3	3	5	4	0	1		0	3	0	4	0
I-136	320	4	2	4	0	0	0	[illegible]	3	2	5	4	0	3		1	3	0	4	0
I-137	320	4	5	5	3	2	2	4	3	4	5	5	3	5		0	4	2	5	5
I-138	320	4	3	5	2	[illegible]	1	3	3	4	5	5	2	5		0	3	1	5	4
I-139	320	5	3	5	I	0	I	0	3	4	5	5	2	5		0	3	I	5	4
I-141	320	3	I	4	0	0	0	0	3	3	4	3	1	3		0	I	0	4	4
I-142	320	1	0	3	0	0	0	0	0	1	4	2	1	0		0	0	0	3	0
I-143	320	2	0	4	0	0	0	0	2	2	4	3	2	3		0	1	0	2	3
I-144	320	3	2	5	2	[illegible]	1	0	2	4	5	5	3	4	0	0	4	1	5	4
I-145	320	5	4	5	3	[illegible]	2	3	3	4	5	5	1	5	3	0	3	2	5	3
I-146	320	5	5	5	4	2	4	4	4	5	5	5	5	5	5	0	5	3	5	5
I-147	320	4	3	4	3	2	3	3	3	4	5	5	3	5	0	0	3	3	5	5
I-148	320	4	3	5	1	[illegible]	2	2	3	5	5	5	4	5	3	0	3	0	5	4
I-149	320	4	3	4	1	[illegible]	1	2	3	3	5	5	3	5	1	0	3	0	5	5
I-150	320	4	3	5	3	[illegible]	3	3	3	5	5	5	4	5	3	0	4	3	5	5
I-151	320	5	3	5	3	[illegible]	3	2	3	5	5	5	4	5	0	0	4	3	5	5
I-152	320	4	3	4	2	0	I	[illegible]	3	4	5	4	1	3	0	0	3	0	4	I
I-153	320	4	4	5	3	[illegible]	1	2	3	4	5	5	4	4	3	0	5	2	5	3

[表70]

No.	処理薬量（g／ha）	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
I-'84	320	3	2	3	0	0	0	0	2	2	5	4	0	3	C	0	2	0	4	0
I-:85	320	3	I	3	0	0	0	0	3	3	5		0	2	0	0	3	0	5	0
1-'86	320	2	1	4	1	'	1	2	3	3	5	4	1	3	C	0	3	1	3	0
1 '87	320	3	1	3	1	'	1	'	3	3	5		1	2	0	0	3	1	4	2
1-'88	320	5	4	5	3	'	2	3	4	4	5	5	3	4	C	0	4	2	5	3
I-'89	320	4	4	5	2	'	2	2	3	3	5	5	2	3	C	0	3	I	4	I
1-'8C	320	1	0	2	0	0	0	0	3	1	4	3	0	1	C	0	2	0	2	0
1-'81	320	3	0	3	0	0	0	0	1	0	4	0	0	1	C	0	1	0	'	0
1-:82	320	3	1	4	1	:	1	0	3	4	4	3	2	3	C	0	3	0	3	1
1-'83	320	4	3	5	2	'	1	'	4	4	5	4	3	2	C	0	4	1	4	3
1 :84	320	5	5	5	3	:	1	3	4	5	5		4		4	0	5	3	5	4
I-'85	320	3	1	4	0	0	0	2	3	4	5	4	2	4	C	0	1	0	5	4
I :86	320	5	4	5	I	0	I	:	3	4	5	4	I		0	0	4	0	5	4
1-'87	320	C	0	2	1	0	1	'	2	2	5	5	2	4	C	0	1	0	5	0
I-'88	320	5	4	5	I	0	I	0	3	3	5	5	I	5	3	0	3	I	5	3
1-:89	320	4	3	5	1	:	1	:	3		5	5	1	4	0	1	5	1	5	0
1 '7C	320	4	3	4	1	0	1	'	3	3	5	4	2	4	C	0	2	0	5	3
1-'71	320	2	3	5	0	0	0	'	4	4	5	5	2	3	C	0	3	0	5	3
1-'72	320	5	4	5	2	'	1	'	5	5	5	5	4	4	3	0	4	1	5	4
1 :73	320	4	3	5	2	:	1	:	5	5	5	5	4	4	3	0	4	1	5	4
1-'74	320	C	0	C	0	0	0	0	0	4	5	3	3	3	C	0	0	0	4	0
2 001	320	3	0	4	1	0	1	0	5	5	5	5	4	5	C	0	2	0	5	4
2-002	320	4	3	5	3	'	1	'	5	5	5	5	4	5	2	0	3	1	5	4
2 003	320	5	5	5	3	3	3	5	5	5	5	5	4	5	4	I	4	3	5	5
2-005	320	5	4	5	3	3	2	4	5	5	5	5	4	5	C	1	3	3	5	4
2-006	320	5	5	5	3	2	I	4	5	5	5	5	3	5	5	I	4	3	5	4
2-007	320	5	4	5	3	2	2	4	5	5	5	5	1	5	2	0	3	2	5	4
2-008	320	3	2	4	3	'	2	'	5	5	5	5	3	4	I	0	3	2	5	3
2-009	320	4	3	5	3	:	2	:	5	5	5	5	4	4	2	1	4	1	5	4
2-01C	320	4	3	5	4	3	3	2	5	5	5	5	4	5	5	3	4	3	5	5
2 011	320	5	3	5	3	3	2	3	5	5	5	5	3	5	5	1	4	1	5	1
2-012	320	4	1	4	3	2	2	2	5	5	5	5	4	4	5	3	4	4	5	4
2 013	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	4	5	3	4	4	5	4
2-014	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	4	5	5	3	4	4	5	4
2 015	320	5	4	5	2	2	2	2	5	5	5	4	3	3	4	2	2	2	4	3
2-016	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	3	5	5	1	4	4	5	4
2-017	320	5	5	5	4	3	2	4	5	5	5	5	I	5	5	I	4	3	5	4
2 018	320	2	I	1	0	0	0	0	3	3	3	0	1	2	C	0	0	0	:	0
2-019	320	5	5	5	3	2	2	4	5	5	5	5	3	5	4	0	4	3	5	4
2-02C	320	3	3	3	I	0	I	:	5	4	5	4	2	4	2	0	3	I	5	3
2-021	320	5	5	5	3	3	3	4	5	5	5	5	4	5	4	0	4	3	5	4
2 022	320	4	5	5	4	3	3	5	5	5	5	5	4	5	5	I	5	3	5	5
2-023	320	1	1	4	0	0	0	0	3	3	4	3		4	0	0	1	0	4	1
2 024	320	5	5	5	4	3	4	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5	4	5	5
2-025	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	5	1	4	3	5	4
2-026	320	5	4	5	3	4	3	3	5	5	5	5	4	5	5	2	5	3	5	5
2 027	320	5	5	5	3	4	3	4	5	5	5	5	4	5	4	0	1	3	5	4

[表71]

No.	処理薬量（g／ha）	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
2-028	320	5	5	5	4	4	4	5	5	5	5	5	4	5	5	3	4	4	5	5
2-029	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	5	5	5	5
2-030	320	5	5	5	4	3	3	5	5	5	5	5	3	5	5	0	4	3	5	5
2-031	320	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2-032	320	5	5	5	5	3	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2-033	320	5	5	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	5
2-034	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5
2-035	320	5	5	5	4	3	4	4	5	5	5	5	2	5	5	2	4	4	5	5
2-036	320	5	4	5	1	0	0	3	5	5	5	5	4	4	0	0	2	0	5	3
2-037	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
2-038	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2-039	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	4	3	4	3	5	5
2-040	320	5	3	5	3	1	1	3	5	5	5	5	4	5	4	1	4	2	5	3
2-041	320	4	3	5	3	3	3	4	5	4	5	5	4	4	2	0	4	3	5	4
2-042	320	5	5	5	2	2	1	0	5	5	5	3	1	5	4	0	3	0	4	2
2-043	320	5	4	5	4	3	2	4	5	5	5	5	4	5	3	1	4	3	5	4
2-044	320	5	4	5	2	2	2	3	5	5	5	4	3	5	3	2	4	1	5	3
2-045	320	5	4	5	2	1	1	3	5	5	5	5	3	5	4	3	4	1	5	5
2-046	320	0	1	3	0	0	0	0	4	4	4	2	1	1	0	0	0	0	2	0
2-047	320	5	3	5	3	1	1	3	5	5	5	4	3	5	3	0	3	3	5	3
2-048	320	5	5	5	4	3	4	4	5	5	5	4	4		4	4	5	4	5	5
2-049	320	5	5	5	3	1	3	4	4	3	5		3	4	2	1	4	0	4	3
2-050	192	3	1	3	2	0	0	0	3	2	5	3	0	3	0	0	3	0	3	0
2-051	320	5	5	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	4	2	4	4	5	4
2-052	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5			5	4	5	5	5	5
2-053	320	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5		5	4	5	5	5	5
2-054	320	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	4		5	5	5	5	5	5
2-055	131	0	0	0	0	0	0	0	4	3	5	4	0		0	0	1	0	1	0
2-056	320	5	3	4	1	1	1	1	4	4	5	5	4		0	1	3	1	5	3
2-057	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	4	5	4	2	5	4	5	5
2-058	320	5	5	5	5	4	4	4	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5
2-059	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	5	5	5	3	5	4	5	5
2-060	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	5	2	4	4	5	5
2-061	320	5	5	5	4	3	4	3	4	5	5	5	3	5	5	3	4	3	5	4
2-062	320	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5
2-063	320	5	5	5	4	3	3	3	5	5	5	5	4	5	4	3	4	3	5	4
2-064	320	3	2	3	0	0	0	0	5	5	5	5	1	5	0	0	3	0	4	3
2-065	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	3	5	3	4	4	3	5	4
2-066	320	5	5	5	2	3	3	3	4	5	5	5	3	5	4	1	4	3	5	4
2-067	320	5	5	5	5	4	4	3	5	5	5	5	4	5	5	4	5	4	5	5
2-068	320	5	5	5	3	2	2	3	5	5	5	5	4	5	5	3	4	2	5	4
2-069	320	5	5	5	5	3	3	4	5	5	5	5	4	5	5	4	4	3	5	5
2-070	320	5	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	4	5	5	4	3	4	5	5
2-071	320	5	4	5	2	1	1	1	4	5	5	5	3	5	1	2	3	1	5	4
2-072	320	5	5	5	1	1	1	3	5	5	5	5	3	5	1	3	4	1	5	4
2-073	320	1	1	4	1	0	1	0	3	3	5	4	0	2	0	0	2	0	3	0
2-074	320	5	4	5	4	3	3	3	4	5	5	4	3	5	5	3	4	3	5	4

[表72]

No.	処理薬量 (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
2-075	320	5	5	5	5	4	4	4	5	5	5	5	4	5	5	3	5	4	5	5
2-076	320	3	3	5	1	-	1	2	4	5	5	5	3	5	1	0	1	0	5	4
2-077	320	4	2	4	0	0	0	0	4	5	5	4	3	3	0	0	2	0	5	2
2-078	320	5	5	5	3	4	4	5	5	5	5	5	4	5	4	1	4	2	5	5
2-079	320	5	5	5	3	4	2	5	5	5	5	5	4	5	5	2	4	2	5	5
2-080	320	5	3	5	1	-	0	3	5	5	5	4	4	5	3	0	4	0	5	5
2-081	320	4	3	5	3	-	1	1	4	5	5	5	3	4		0	3	2	5	4
2-082	320	5	5	5	2	4	4	4	5	5	5	5	4	4		1	5	4	5	5
2-083	320	5	4	5	2	-	1	1	5	5	5	4	3	4		0	4	0	5	1
2-084	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	3		1	3	3	5	3
2-085	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	4		2	5	3	5	4
2-086	320	5	5	5	3	-	2	4	5	5	5	4	4	5		0	4	2	5	3
2-087	320	5	4	5	4	3	3	4	5	4	5	5	3			0	3	2	5	3
2-088	141	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	3	4		0	4	0	5	5
2-089	320	4	4	4	1	2	1	4	4	4	5	5	3	5		0	4	0	5	4
2-090	320	5	4	5	4	3	4	4	3	4		5	4	3	3	1	3	3	5	4
2-091	320	5	5	5	3	2	3	3	4	4	5	5	4	4	2	0	3	3	5	5
2-092	320	0	0	2	1	0	0	0	1	1	3	3	-	1	0	0	1	0	3	0
2-093	320	1	0	1	1	-	1	1	3	2	5	5	2	2	0	0	3	1	2	1
2-094	320	4	4	5	2	-	1	3	5	4	5	5	3	4	3	1	4	1	5	4
2-095	320	5	5	5	4	4	3	5	5	5	5	5	4	4	5	1	5	3	5	5
2-096	320	5	4	5	1	0	0	0	5	5	5	4	3	3	0	0	3	0	5	0
2-097	320	4	3	5	2	-	1	2	3	3	5	4	3	4	0	0	3	0	4	1
2-098	320	5	5	5	4	2	3	4	4	5	5	5	4	4	4	1	4	3	5	4
2-099	320	5	4	5	2	0	1	1	4	4	5	5	4	5	3	0	4	0	5	4
2-100	320	5	4	5	3	2	3	4	5	5	5	5	5	5	5	0	4	0	5	5
2-101	320	5	5	5	3	3	3	4	5	5	5	5	4	5	4	2	5	3	5	5
2-102	320	5	4	5	1	0	1	3	5	5	5	5	3	5	1	0	4	1	5	3
2-103	320	4	3	5	1	0	1	2	4	5	5	5	4	4	2	0	4	0	5	3
2-105	320	5	4	5	4	3	3	4	5	5	5	5	3	5	4	0	4	3	5	5
2-106	320	3	1	3	1	0	0	0	5	4	5	4	3	3	0	0	4	0	5	3
2-107	320	5	3	5	1	0	0	0	5	5	5	5	4	5	3	0	5	0	5	4
2-108	320	4	3	5	1	0	0	0	5	5	5	5	4	5	4	0	4	1	5	5
2-109	256	3	2	4	1	0	1	0	5	5	5	5	3	5	1	0	4	1	5	4
2-110	320	5	4	5	3	2	3	3	5	5	5	5	5	5	4	0	4	3	5	4
3-002	320	0	0	0	0	0	0	0	1	3	4	1	0	0	0	0	0	0	0	0
4-001	320	1	2	3	1	0	0	0	5	5	5	3	3	3	0	0	2	0	2	0
4-002	320	1	1	2	1	0	0	0	5	4	4	3	-	1	0	0	1	0	0	0
4-003	320	2	1	4	0	0	0	1	4	2	5	4	-	2	0	0	4	0	4	1
4-004	320	0	0	0	0	0	0	0	0	0	4	0	0	0	0	0	0	0	0	0
6-001	320	1	2	1	0	0	0	0	3	3	4	4	2	2	0	0	0	0	3	0
6-002	320	4	3	5	1	0	0	0	5	5	5	5	3	4	0	0	3	0	3	3
6-003	320	4	3	3	0	0	0	0	4	2	3	4	-	1	0	0	0	0	1	0
6-004	320	5	4	5	3	-	2	1	5	5	5	4	4	3	0	0	4	1	2	3
6-005	320	3	1	3	0	-	1	1	4	3	3	1	-	1	0	0	0	0	1	0
6-006	320	0	0	0	0	0	0	0	1	0	3	1	0	1	0	0	0	0	0	0
6-007	320	0	0	0	0	0	0	0	2	3	3	0	0	0	0	0	2	0	3	0

[表73]

No.	処理薬量（g／ha）	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
5-008	320	0	0	0	0	C	0	0	1	0	3	1	C	0	0	0	1	0	1	0
7-001	320	0	0	1	0	C	0	0	1	0	2	1	C	0	0	0	0	0	0	0
7-002	320	3	2	4	1	C	0	0	3	4	5	4	3	3	0	0	2	0	4	3

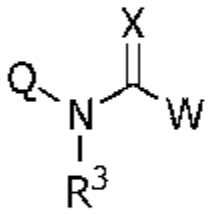
産業上の利用可能性

[0293] 本発明の複素環アミド化合物は新規な化合物であり、イネ用、トウモロコシ用、ダイズ用、麦用、ビート用及びナタネ用の選択性除草剤として有用である。

請求の範囲

[請求項1] 式（１）：

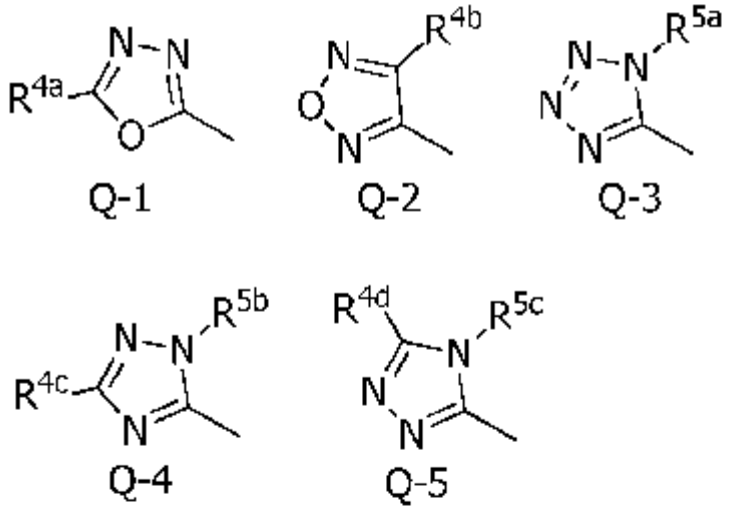
[化1]



(1)

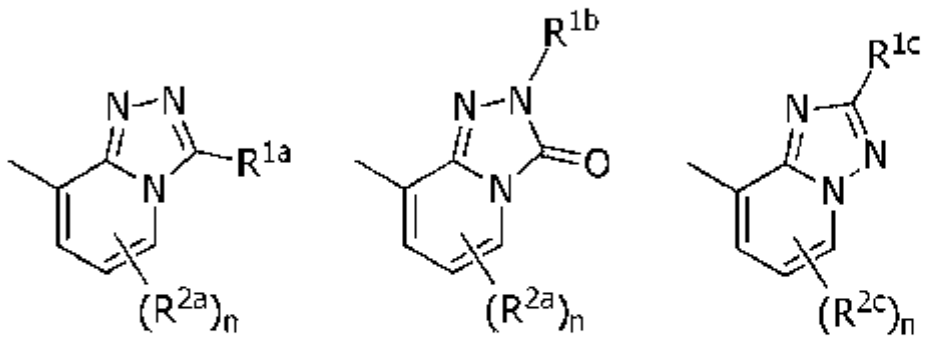
［式中、Ｑは、Ｑ－１からＱ－５の何れかで示される芳香族複素環を表し、

[化2]



Ｗは、Ｗ－１、Ｗ－２又はＷ－３で示される芳香族複素環を表し、

[化3]



Xは、酸素原子又は硫黄原子を表し、

R^{1a}は、水素原子、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、R^6によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、R^5によって任意に置換された（C_3～C_6）シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_3～C_6シクロアルケニル、－C（O）R^8、－C（O）OR^{15}、シアノ、－OR^9、－S（O）$_{m1}R^{10}$、－N（R^{11}）R^{12}、－C（＝NR^{13a}）R^{8b}、フェニル、（R’）$_p$によって置換されたフェニル、ナフチル又はU－１からU－２５の何れかの基を表し、

R^{1b}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^6によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、R^6によって任意に置換された（C_3～C_6）シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキニル、フェニル、（R’）$_p$によって置換されたフェニル、ナフチル、５－６員ヘテロアリール、（R^{28}及びR^{28a}によって任意に置換された）５－６員ヘテロアリール、３－７員ヘテロシクリル又は（R^{28}及びR^{28a}によって任意に置換された）３－７員ヘテロシクリルを表し、

R^{1c}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{2a}は、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、－C（O）R^{18}、－C（O）OR^{24}、シアノ、ニトロ、－OR^1

^{g}、－Ｓ（Ｏ）$_{m3}$Ｒ^{20}、－Ｎ（Ｒ^{21}）Ｒ^{22}、フェニル又は（Ｒ^{7}）$_{o}$によって置換されたフェニルを表し、ｎが２以上の整数を表すとき、各々のＲ^{2a}は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、更に、２つのＲ^{2a}が隣接する場合には、隣接する２つのＲ^{2a}は、－ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ－を形成することにより、それぞれのＲ^{2a}が結合する炭素原子と共に６員環を形成してもよく、

Ｒ^{2b}は、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキルを表し、

Ｒ^{3}は、水素原子、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｒ^{27}によって任意に置換された（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$シクロアルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$ハロシクロアルキル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$ハロアルケニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキニル、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{25}又は－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{26}を表し、

Ｒ^{4a}は、水素原子、ハロゲン原子、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｒ^{27}によって任意に置換された（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$シクロアルキル、Ｒ^{27}によって任意に置換された（Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$）シクロアルキル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$ハロアルケニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキニル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$シクロアルケニル、－ＮＨ$_{2}$、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルアミノ、ジ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル）アミノ、－ＮＨＣ（Ｏ）Ｒ^{8}、フェニル、（Ｒ^{28}）$_{n}$によって置換されたフェニル、５－６員ヘテロアリール、（Ｒ^{28}及びＲ^{28a}によって任意に置換された）５－６員ヘテロアリール、３－７員ヘテロシクリル又は（Ｒ^{28}及びＲ^{28a}によって任意に置換された）３－７員ヘテロシクリルを表し、

Ｒ^{4b}は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｒ^{27}によって任意に置換された（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$シクロアルキル、Ｒ^{27}によって任意に置換された（Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$）シクロアルキル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$ハロアルケニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキニル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$シクロア

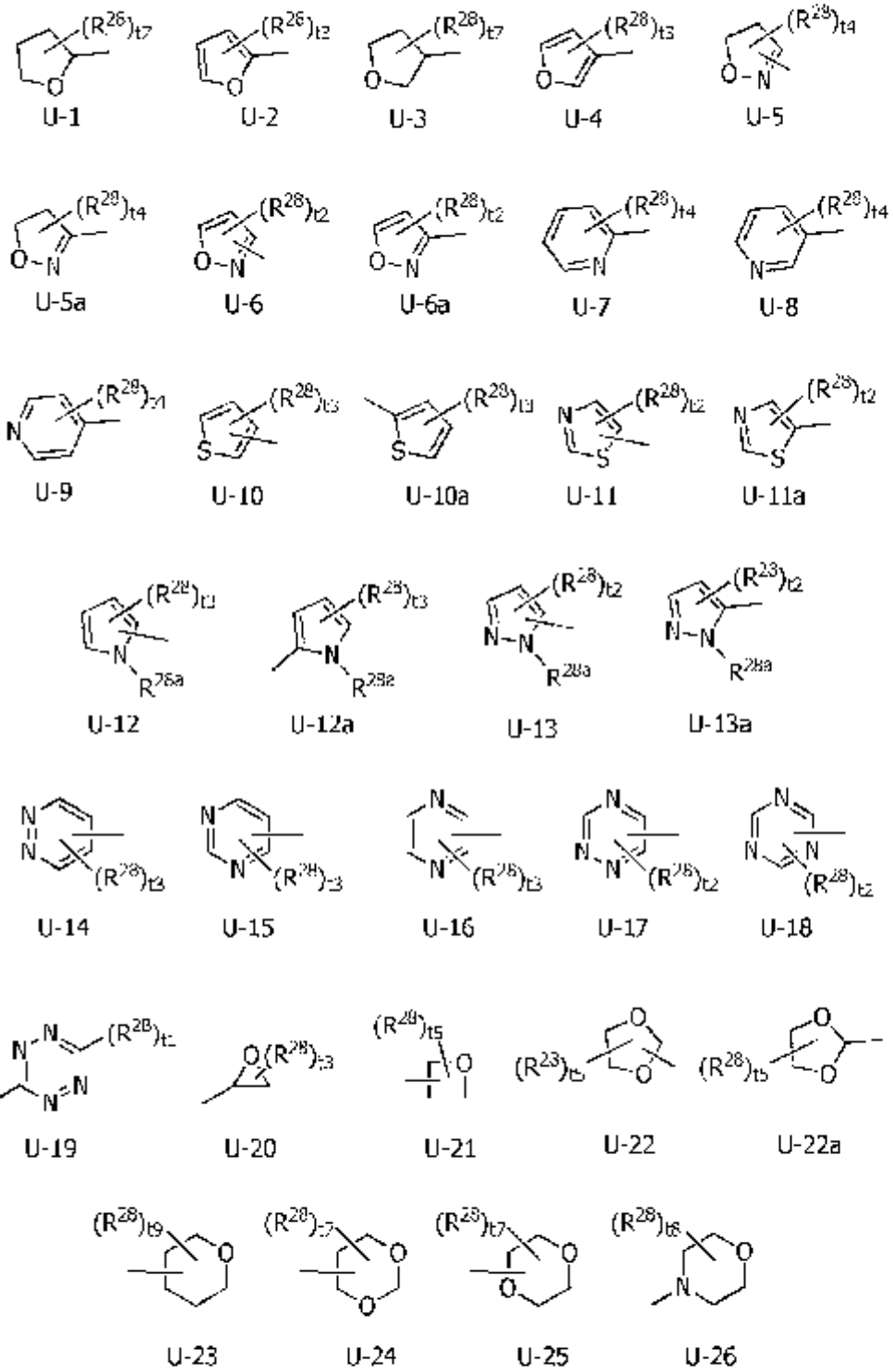
ルケニル、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{18}、－ＯＲ^{38}、－Ｓ（Ｏ）$_{m3}$Ｒ^{20}、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルアミノ、ジ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）アミノ、－ＮＨＣ（Ｏ）Ｒ^6、フェニル、（Ｒ^{28}）$_r$によって置換されたフェニル、５－６員ヘテロアリール、（Ｒ^{28}及びＲ^{28a}によって任意に置換された）５－６員ヘテロアリール、３－７員ヘテロシクリル又は（Ｒ^{28}及びＲ^{28a}によって任意に置換された）３－７員ヘテロシクリルを表し、

Ｒ^{4c}は、水素原子、ハロゲン原子、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｒ^{27}によって任意に置換された（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｒ^{27}によって任意に置換された（Ｃ$_3$～Ｃ$_6$）シクロアルキル、フェニル、（Ｒ^{28}）$_r$によって置換されたフェニル、５－６員ヘテロアリール、（Ｒ^{28}及びＲ^{28a}によって任意に置換された）５－６員ヘテロアリール、３－７員ヘテロシクリル又は（Ｒ^{28}及びＲ^{28a}によって任意に置換された）３－７員ヘテロシクリルを表し、

Ｒ^{4d}は、水素原子、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル又はＲ^{38}によって任意に置換された（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルキルを表し、

Ｕ－１乃至Ｕ－６、Ｕ－６ａ、Ｕ－７乃至Ｕ－１０、Ｕ－１０ａ、Ｕ－１１、Ｕ－１１ａ、Ｕ－１２、Ｕ－１２ａ、Ｕ－１３、Ｕ－１３ａ、Ｕ－１４乃至Ｕ－２２、Ｕ－２２ａ、Ｕ－２３、Ｕ－２４、Ｕ－２５、Ｕ－２６は、それぞれ以下の構造で表される複素環を表し、

[化4]



R^{5a}及びR^{5b}は、各々独立して水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6ハロシクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2

～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、C_3～C_6シクロアルケニル、フェニル又は（R^{28}）$_r$によって置換されたフェニルを表し、

R^{5c}は、水素原子、C_1～C_6アルキル又はR^{36}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表すか、或いはR^{5c}は、R^{4d}と－（CH_2）$_4$－又は－CH＝CH－CH＝CH－を形成することにより、R^{5c}が結合する窒素原子及びR^{4d}が結合する炭素原子と共に６員環を形成してもよく、

R^6は、ハロゲン原子、シアノ、C_3～C_6シクロアルキル、－C（O）R^8、－C（O）OR^{16}、－OR^{13}、－S（O）$_{m2}R^{14}$、フェニル又は（R^f）$_p$によって置換されたフェニルを表し、

R^7は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C_1～C_6アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6ハロシクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、C_3～C_6シクロアルケニル、C_1～C_6アルキルカルボニル、C_3～C_6シクロアルキルカルボニル、C_1～C_6ハロアルキルカルボニル、C_3～C_6ハロシクロアルキルカルボニル、C_1～C_6アルコキシカルボニル、C_1～C_6ハロアルコキシカルボニル、C_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_1～C_6ハロアルキルアミノカルボニル、ジ（C_1～C_6アルキルアミノ）カルボニル、－OR^{15}、－S（O）$_{m3}R^{20}$、C_1～C_6アルキルアミノスルホニル、ジ（C_1～C_6アルキル）アミノスルホニル、－NH_2、C_1～C_6アルキルアミノ、ジ（C_1～C_6アルキル）アミノ、５－６員ヘテロアリール、（R^{28}及びR^{28a}によって任意に置換された）５－６員ヘテロアリール、３－７員ヘテロシクリル又は（R^{28}及びR^{28a}によって任意に置換された）３－７員ヘテロシクリルを表し、

R^9は、水素原子、C_1～C_6アルキル又は－N（R^{11a}）R^{12a}を

表し、

R^{6b}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^9は、水素原子、C_1～C_6アルキル又はフェニルを表し、

R^{10}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{31}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6ハロシクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル又はC_2～C_6ハロアルキニルを表し、

R^{11}及びR^{12}は、各々独立して水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{31}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、フェニルスルホニル、フェニル、$(R^f)_p$によって置換されたフェニル、U－7、U－8、U－9又はU－14乃至U－19を表すか、或いは、R^{11}はR^{12}と一緒になってC_2～C_6アルキレン鎖を形成することにより、R^{11}及びR^{12}が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はO、S、S（O）、S（O）$_2$又はN（R^{33}）を1個含んでもよく、且つオキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく、

R^{11a}及びR^{12a}は、各々独立して水素原子、C_1～C_6アルキル又はフェニルを表すか、或いは、R^{11a}はR^{12a}と一緒になってC_2～C_6アルキレン鎖を形成することにより、R^{11a}及びR^{12a}が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はO、S、S（O）、S（O）$_2$又はN（R^{33}）を1個含んでもよく、且つオキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく、

R^{12b}は、－OR^{19b}を表し、

R^{13}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロ

アルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、－C（O）R^5又はフェニルを表し、

R^{14}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{31}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル又はフェニルを表し、

R^{15}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6ハロシクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル又はC_3～C_6シクロアルケニルを表し、

R^{16}は、水素原子、C_1～C_6アルキル又はR^{37}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{18}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{19}は、水素原子、C_1～C_6アルキル又はフェニルを表し、

R^{19b}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{20}は、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル又はC_3～C_6シクロアルケニルを表し、

R^{21}及びR^{22}は、各々独立して水素原子、C_1～C_6アルキル又はフェニルを表すか、或いは、R^{21}はR^{22}と一緒になってC_2～C_6アルキレン鎖を形成することにより、R^{21}及びR^{22}が結合する窒素原子と共に3～7員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はO、S、S（O）、S（O）$_2$又はN（R^{39}）を1個含んでもよく、且つオキソ基又はチオキソ基によって置換されていてもよく、

R^{24}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{25}及びR^{26}は、各々独立しては、水素原子、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6ハロシクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、C_3～C_6シクロアルケニル又はフェニルを表し、

R^{27}は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、フェニル、（R^{28}）$_r$によって置換されたフェニル、－C（O）OR^{16}、－OR^{29}、－S（O）$_{m4}R^{30}$、５－６員ヘテロアリール、（R^{28}及びR^{28a}によって任意に置換された）５－６員ヘテロアリール、３－７員ヘテロシクリル又は（R^{28}及びR^{28a}によって任意に置換された）３－７員ヘテロシクリルを表し、

R^{28}は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6ハロシクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、（C_1～C_6アルコキシ）C_1～C_6アルキル、－OR^{31}又は－S（O）$_{m4}R^{30}$を表し、ｔ２、ｔ３、ｔ４、ｔ５、ｔ７、ｔ８又はｔ９が２以上の整数を表すとき、各々のR^{28}は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、更に２つのR^{28}が隣接する場合には、隣接する２つのR^{28}は一緒になって－CH＝CH－CH＝CH－を形成することにより、それぞれのR^{28}が結合する炭素原子と共に６員環を形成してもよく、

R^{28a}は、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、（C_1～C_6アルコキシ）C_1～C_6アルキル又は（C_1～C_6アルキルチオ）C_1～C_6アルキルを表し、

R^{29}、R^{30}及びR^{31}は、各々独立して、水素原子、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6ハロシクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、C_3～C_6シク

ロアルケニル又はフェニルを表し、

R^{33}は、水素原子、C_1～C_6アルキルを表し

R^{34}は、ハロゲン原子、シアノ、C_3～C_6シクロアルキル、－C（O）R^5、－C（O）OR^{10}、－OR^{33}、－S（O）$_{m6}R^{33}$、フェニル、$(R^7)_p$によって置換されたフェニル、U－1、U－3、U－7、U－8、U－9又はU－14乃至U－25を表し、

R^{35}は、ハロゲン原子又はC_1～C_6アルコキシを表し、

R^{36}は、ハロゲン原子又はC_1～C_6アルコキシを表し、

R^{37}は、C_1～C_6アルコキシを表し、

R^{38}は、C_1～C_6アルキル、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6ハロシクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6ハロアルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_2～C_6ハロアルキニル、C_3～C_6シクロアルケニル又はフェニルを表し、

R^{39}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

t1は、0又は1の整数を表し

m1、m2、m3、m4、m6及びt2は、各々独立して0、1又は2の整数を表し、

n及びt3は、各々独立して0、1、2又は3の整数を表し、

p及びrは、各々独立して1、2、3、4又は5の整数を表し、

t4は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

t5は、0、1、2、3、4又は5の整数を表し、

t7は、0、1、2、3、4、5、6又は7の整数を表し、

t8は、0、1、2、3、4、5、6、7又は8の整数を表し、

t9は、0、1、2、3、4、5、6、7、8又は9の整数を表す。］で表される複素環アミド化合物又はその塩。

［請求項2］ Wは、W－1又はW－2で示される芳香族複素環を表し、

R^{28}は、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、

－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{15}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{24}、シアノ、ニトロ、－ＯＲ^{19}又は－Ｓ（Ｏ）$_{m2}$Ｒ^{20}を表し、ｎが２以上の整数を表すとき、各々のＲ^{20}は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよい請求項１記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項3] Ｒ^{1b}は、水素原子、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｒ^{6}によって任意に置換された（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｒ^{6}によって任意に置換された（Ｃ$_3$～Ｃ$_6$）シクロアルキル、Ｃ$_2$～Ｃ$_6$アルケニル、Ｃ$_2$～Ｃ$_6$アルキニル、フェニル、（Ｒ^7）$_p$によって置換されたフェニル、ナフチル又はＵ－１からＵ－２５の何れかの基を表し、

Ｒ^{2a}は、水素原子、ハロゲン原子、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｒ^{27}によって任意に置換された（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｒ^{27}によって任意に置換された（Ｃ$_3$～Ｃ$_6$）シクロアルキル、Ｃ$_2$～Ｃ$_6$アルケニル、Ｃ$_2$～Ｃ$_6$ハロアルケニル、Ｃ$_2$～Ｃ$_6$アルキニル、Ｃ$_2$～Ｃ$_6$ハロアルキニル、Ｃ$_3$～Ｃ$_6$シクロアルケニル、－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルアミノ、ジ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）アミノ、－ＮＨＣ（Ｏ）Ｒ^8、フェニル、（Ｒ^{28}）$_n$によって置換されたフェニル又はＵ－１からＵ－２６の何れかの基を表し、

Ｒ^{7}は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル、Ｒ^{27}によって任意に置換された（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$）アルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_6$シクロアルキル、Ｃ$_3$～Ｃ$_6$ハロシクロアルキル、Ｃ$_2$～Ｃ$_6$アルケニル、Ｃ$_2$～Ｃ$_6$ハロアルケニル、Ｃ$_2$～Ｃ$_6$アルキニル、Ｃ$_2$～Ｃ$_6$ハロアルキニル、Ｃ$_3$～Ｃ$_6$シクロアルケニル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルカルボニル、Ｃ$_3$～Ｃ$_6$シクロアルキルカルボニル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキルカルボニル、Ｃ$_3$～Ｃ$_6$ハロシクロアルキルカルボニル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシカルボニル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシカルボニル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルアミノカルボニル、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキルアミノカルボニル、ジ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルアミノ）カルボニル、－ＯＲ^{19}、－Ｓ（Ｏ）$_{m3}$Ｒ^{20}、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルアミノスルホニル、ジ（Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキル）ア

ミノスルホニル、－NH_2、C_1～C_6アルキルアミノ、ジ（C_1～C_6アルキル）アミノ又はＵ－１からＵ－２６の何れかの基を表し、

R^{27}は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、フェニル、（R^{28}）$_r$によって置換されたフェニル、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{19}、－ＯＲ^{20}、－Ｓ（Ｏ）$_{m1}$Ｒ^{30}又はＵ－１からＵ－２６の何れかの基を表す請求項２記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項4] R^{1a}は、水素原子、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、R^5によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、R^6によって任意に置換された（C_3～C_6）シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_3～C_6シクロアルケニル、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^8、－ＯＲ^9、－Ｓ（Ｏ）$_{n1}$Ｒ^{10}、－Ｎ（Ｒ^{11}）Ｒ^{12}、－Ｃ（＝ＮＲ^{12a}）Ｒ^{8b}、フェニル、（Ｒ^5）$_p$によって置換されたフェニル、Ｕ－３、Ｕ－５ａ、Ｕ－６ａ、Ｕ－７、Ｕ－８、Ｕ－１０ａ、Ｕ－１１ａ、Ｕ－１２ａ、又はＵ－１３ａを表し、

R^{1b}は、C_1～C_6アルキル又はR^5によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{2a}は、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、－Ｓ（Ｏ）$_{m3}$Ｒ^{20}、ｎが２以上の整数を表すとき、各々のR^{2a}は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^3は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{4a}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、フェニル、（R^{28}）$_r$によって置換されたフェニル、Ｕ－１、Ｕ－２、Ｕ－７、Ｕ－１０ａ又はＵ－２６で示される複素環を表し、

R^{4b}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{4c}は、水素原子を表し、

R^{4d}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{5a}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{27}によって任意に置換

された（C_1～C_6）アルキル、C_2～C_6アルケニル又はフェニルを表し、

R^{5b}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{5c}は、C_1～C_6アルキルを表すか、或いはR^{5c}は、R^{4d}と－（CH_2）$_4$－又は－CH＝CH－CH＝CH－を形成することにより、R^{5c}が結合する窒素原子及びR^{4d}が結合する炭素原子と共に６員環を形成してもよく、

R^7は、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル又は－OR^{1b}を表し、

R^{8b}は、水素原子を表し、

R^9は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{10}は、C_1～C_6アルキル、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル又はC_2～C_6アルキニルを表し、

R^{11}は、C_1～C_6アルキル、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキニル、フェニルスルホニル、フェニル、（R^f）$_p$によって置換されたフェニル又はＵ－７を表し、

R^{12}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{11}はR^{12}と一緒になってC_4～C_5アルキレン鎖を形成することにより、R^{11}及びR^{12}が結合する窒素原子と共に５～６員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はＯ、Ｓ、Ｓ（Ｏ）又はＳ（Ｏ）$_2$を１個含んでもよく、

R^{11a}は、C_1～C_5アルキルを表し、

R^{12a}は、水素原子を表し、

R^{13}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_5）アルキル、－Ｃ（Ｏ）R^8又はフェニルを表し、

R^{14}は、C_1～C_6アルキル又はR^{34}によって任意に置換された（

C_1～C_6）アルキルを表し、

R^{15}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{19b}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{20}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{27}は、ハロゲン原子、フェニル、$(R^{28})_r$によって置換されたフェニル、－ＯＲ^{29}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{16}又は－Ｓ（Ｏ）$_{n4}$Ｒ^{30}を表し、

R^{28}は、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル又は－ＯＲ^{31}を表し、ｔ２、ｔ３、ｔ４、ｔ５又はｔ７が２以上の整数を表すとき、各々のR^{28}は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、更に２つのR^{28}が隣接する場合には、隣接する２つのR^{28}は一緒になって－ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ＝ＣＨ－を形成することにより、それぞれのR^{28}が結合する炭素原子と共に６員環を形成してもよく、

R^{29}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{30}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{31}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{33}は、C_1～C_6アルキルを表し、

R^{34}は、ハロゲン原子、シアノ、C_3～C_6シクロアルキル、－Ｃ（Ｏ）Ｒ^{8}、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ^{16}、－ＯＲ^{33}、－Ｓ（Ｏ）$_{m6}$Ｒ^{33}、フェニル、$(R^{7})_p$によって置換されたフェニル、Ｕ－１、Ｕ－８又はＵ－２２ａを表す請求項３記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項5] Ｑは、Ｑ－１で示される芳香族複素環を表し、

Ｗは、Ｗ－１で示される芳香族複素環を表す請求項４記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項6] Ｘは、酸素原子を表し、

R^{5}は、水素原子、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、R^{6}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、R^{b}によって任意に置換された（C_3～C_6）シクロアルキル、C_2～C_6

アルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_3～C_6シクロアルケニル、－C（O）R^8、－OR^5、－S（O）$_{n'}R^9$、－N（R^{11}）R^{12}、－C（＝NR^{12a}）R^{8b}、フェニル、（R^7）$_p$によって置換されたフェニル、U－5a、U－6a、U－7、U－8、U－10a、U－11a、U－12a、又はU－13aを表し、

R^{29}は、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、－S（O）$_{n3}R^{30}$、nが2以上の整数を表すとき、各々のR^{29}は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^6は、ハロゲン原子、シアノ、C_3～C_5シクロアルキル、－C（O）R^8、－C（O）OR^{13}、－OR^{13}、－S（O）$_{n2}R^{14}$又は（R^7）$_p$によって置換されたフェニルを表し、

R^{27}は、ハロゲン原子、フェニル、－OR^{29}又は－S（O）$_{n'}R^{30}$を表す請求項5記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項7] R^{4a}は、水素原子、C_1～C_6アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキルを表し、

R^{27}は、ハロゲン原子、－OR^{29}を表す請求項6記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項8] Qは、Q－3で示される芳香族複素環を表し、

Wは、W－1で示される芳香族複素環を表す請求項4記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項9] R^{1a}は、水素原子、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、R^6によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、R^6によって任意に置換された（C_3～C_6）シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキニル、－C（O）R^8、－S（O）$_{n1}R^{10}$、－N（R^{11}）R^{12}、フェニル、（R^7）$_p$によって置換されたフェニル、U－3、U－5a、U－6a、U－8、U－10a、又はU－13aを表し、

R^{2A}は、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキ

ルを表し、ｎが２以上の整数を表すとき、各々のR^{28}は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^6は、ハロゲン原子、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{16}、－ＯR^{13}、－Ｓ（Ｏ）$_{m2}R^{17}$又は（R^7）$_p$によって置換されたフェニルを表し、

R^7は、ハロゲン原子、C_1～C_6アルキル又は－ＯR^{15}を表し、

R^8は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{11}は、C_1～C_6アルキル、R^{34}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキニル、フェニル又は（R^f）$_p$によって置換されたフェニルを表し、

R^{11}はR^{12}と一緒になってC_5アルキレン鎖を形成することにより、R^{11}及びR^{12}が結合する窒素原子と共に６員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖はＯ、Ｓ、Ｓ（Ｏ）又はＳ（Ｏ）$_2$を１個含んでもよく、

R^{16}は、水素原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{27}は、（R^{28}）$_r$によって置換されたフェニル、－ＯR^{29}、－Ｃ（Ｏ）ＯR^{16}又は－Ｓ（Ｏ）$_{n2}R^{30}$を表し、

R^{28}は、ハロゲン原子又はC_1～C_6アルキルを表し、

R^{34}は、ハロゲン原子、シアノ、C_3～C_6シクロアルキル、－ＯR^{33}、－Ｓ（Ｏ）$_{n6}R^{33}$、フェニル、（R^f）$_p$によって置換されたフェニル、Ｕ－１又はＵ－８を表す請求項８記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項10] R^{5a}は、C_1～C_6アルキル、R^{27}によって任意に置換された（C_1～C_6）アルキル又はC_2～C_5アルケニルを表し、

R^{27}は、－ＯR^{29}又は－Ｓ（Ｏ）$_{n2}R^{30}$を表す請求項９記載の複素環アミド化合物又はその塩。

[請求項11] 請求項１～請求項２記載の複素環アミド化合物及びその塩から選ばれる１種又は２種以上を有効成分として含有する農薬。

[請求項12] 請求項１～請求項２記載の複素環アミド化合物及びその塩から選ばれる１種又は２種以上を有効成分として含有する除草剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2014/064492

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
C07D471/04(2006.01)i, *A01N43/90*(2006.01)i, *A01P13/02*(2006.01)i

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
C07D471/04, A01N43/90, A01P13/02

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAplus/REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2012/098579 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG), 08 March 2012 (08.03.2012), entire text; particularly, claim 1 & JP 2013-536817 A & US 2012/0058892 A1 & EP 2611785 A & AU 2011298424 A & CA 2809687 A & CN 103282356 A & TW 201221059 A & AR 82828 A & CO 6670599 A	1-12
A	WO 2012/123409 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG), 20 September 2012 (20.09.2012), entire text; particularly, claim 1 & EP 2686315 A & AU 2012229355 A & CA 2830089 A & CN 103596945 A	1-12

[×] Further documents are listed in the continuation of Box C. [ ] See patent family annex.

* Special categories of cited documents:
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
26 August, 2014 (26.08.14)	19 August, 2014 (19.08.14)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 2009)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2014/064492

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2012/123416 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG), 20 September 2012 (20.09.2012), entire text; particularly, claim 1 & EP 2686316 A & CN 103459386 A & AR 85811 A	1-12
A	WO 2012/126932 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG), 27 September 2012 (27.09.2012), entire text; particularly, claim 1 & EP 2688885 A & AU 2012230388 A & CA 2830773 A & MX 2013010678 A & CN 103596946 A & AR 85469 A	1-12
A	WO 2013/017559 A1 (BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH), 07 February 2013 (07.02.2013), entire text; particularly, claim 1 & AR 87385 A1 & CN 103717581 A & EP 2739611 A1	1-12
A	WO 2013/064457 A1 (BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH), 10 May 2013 (10.05.2013), entire text; particularly, claim 1 & EP 2588598 A1	1-12
A	WO 2013/072402 A1 (BASF SE), 23 May 2013 (23.05.2013), entire text; particularly, claim 1 (family: none)	1-12
A	JP 2007-506788 A (Rigel Pharmaceuticals, Inc.), 22 March 2007 (22.03.2007), entire text; particularly, claim 1 & US 2005/0090521 A1 & US 2007/0149520 A1 & EP 1668009 A & WO 2005/030774 A1 & CA 2540021 A	1-12

国際調査報告	国際出願番号 PCT／JP2014／064192

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））

Int.Cl. C07D417/04(2006.01)i, A01N43/90(2006.01)i, A01P13/02(2006.01)i

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC））

Int.Cl. C07D417/04, A01N43/90, A01P13/02

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）

CAplus/REGISTRY(STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献のカテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する請求項の番号
A	WO 2012/028579 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG) 2012.03.08, 文献全体、特に、請求項1参照 & JP 2013-536817 A & US 2012/0058892 A1 & EP 2611785 A & AU 2011298421 A & CA 2809487 A & CN 103282354 A & BR 201390265 A & MX 2013001937 A & KR 10 2013 0101506 A & LY 33583 A & TW 201221059 A & AR 82828 A & CO 6670599 A	1－12
A	WO 2012/123109 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG) 2012.09.20, 文献全体、特に、請求項1参照 & EP 2686315 A & AU 2012228355 A & CA 2830089 A & MX 2013010395 A & CN 103596945 A & AR 85678 A	1－12

☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー
「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）
「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献
「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日	国際調査報告の発送日
06.08.2014	19.08.2014

国際調査機関の名称及びあて先	権限のある職員	AP	9660
日本国特許庁（ISA／JP） 郵便番号100－8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	谷尾 至 電話番号 03－3581－1101 内線 3492		

様式PCT／ISA／210（第2ページ）（2009年7月）

C（続き）．　関連すると認められる文献

引用文献のカテゴリー*	引用文献名　及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する請求項の番号
A	WO 2012/123116 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG) 2012.09.20, 文献全体、特に、請求項1参照 & EP 2686316 A & CN 103459386 A & AR 85811 A	1－12
A	WO 2012/126932 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG) 2012.09.27, 文献全体、特に、請求項1参照 & EP 2688886 A & AU 2012230388 A & CA 2830773 A & MX 2013010678 A & CN 103596946 A & AR 85469 A	1－12
A	WO 2013/017559 A1 (BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH) 2013.02.07, 文献全体、特に、請求項1参照 & AR 87385 A1 & CA 103717581 A & EP 2739611 A1	1－12
A	WO 2013/064457 A1 (BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH) 2013.05.10, 文献全体、特に、請求項1参照 & EP 2589598 A1	1－12
A	WO 2013/072402 A1 (BASF SE) 2013.05.23, 文献全体、特に、請求項1参照（ファミリーなし）	1－12
A	JP 2007-506788 A (ジェネリック ファーマシューティカルズ, インコーポレイテッド) 2007.03.22, 文献全体、特に、請求項1参照 & US 2005/0090521 A1 & US 2007/0149520 A1 & EP 1668009 A & WO 2005/030771 A1 & CA 2540021 A	1－12

委任状（コピー）

整理番号 P2014-6281-04
案件 GF-9131

OLARTEMOURE
OLARTE MOURE & ASOCIADOS LTDA.

Carlos R. Olarte
Juan G. Moure

Alexander Agudelo
Carlos A. Parra
Juan F. Acosta
Andrés Rincón
Mónica Guevara
Andrés Alvarado
María C. Calderón
Mauricio Ávila
Gina Cáceres
Isabella Herrera
Zaava Ravid
Alejandro Moure
Miguel F. Porras
Catalina Amaya
Laura M. Escobar
Lorena Andrade
Sergio Arboleda
Catalina Jiménez
Daniela González
Maritza Sierra
Gina A. Arias
Guillermo Parra
Erika Jhiset Suárez

Medellín
María C. Múnera
Eddie Manotas
Adrián Santamaría
Camilo A. Bernal

Barranquilla
Gina De Echeona
José J. Dangond

General Power

Poder General

The undersigned,

El suscrito,

NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.

domiciled in

domiciliado en

7-1, KANDA-NISHIKI-CHO 3-CHOME, CHIYODA-KU, TOKYO 1010054, JAPAN

hereby appoint **Carlos R. Olarte and/or Juan Guillermo Moure** legal representatives with faculties to receive notifications **for the prosecution of Colombian national phase of International Patent Application No. PCT/JP2014/064492**, to initiate before all authorities all the necessary actions to accomplish said purposes and to intervene in all instances, grades and procedural levels; to file and prosecute applications, declarations, complaints, to claim, counterclaim, answer claims and counterclaims; to make amendments; oppositions and all types of objections and writings of any nature; cancellations and administrative injunction proceedings; to pay all installments and effect all other payments prescribed by law; to receive documents and monies; act as complainants as well as defendants, before the competent judges, with full powers to request preliminary injunctions of any nature, settle, make arrangements, to submit to arbitrators, to desist from claims or procedures, to accept claims, to collect, to ratify legal proceedings subscribed before the appointment and/or presentation of this Power, substitute or delegate the legal representation and other acts prescribed by law, in short, with all such further powers as may be required; to comply with all other requirements and, to take all those measures which they may deem fit for the protection of our interests.

nombramos por el presente a **Carlos R. Olarte y/o Juan Guillermo Moure** nuestros representantes legales con facultades para recibir notificaciones **para el trámite de la fase nacional colombiana de la solicitud de patente internacional PCT/JP2014/064492**, para iniciar ante cualquier autoridad todas las acciones necesarias para cumplir con el objeto indicado e intervenir en todas las instancias, grados o etapas procesales; elevar y tramitar solicitudes, declaraciones y reclamos, para demandar, reconvenir, contestar demandas y reconvenciones; formular enmiendas, oposiciones y todo tipo de impugnaciones y escritos de cualquier naturaleza; instaurar cancelaciones y amparos administrativos; abonar todos los impuestos y cuotas y efectuar cualquier otro pago determinado por la ley; recibir todos los documentos y valores; intervenir como demandantes o demandados ante los jueces que sean competentes, pudiendo solicitar medidas cautelares de cualquier naturaleza, conciliar, transar, someter a árbitros, desistirse de la pretensión y/o el procedimiento, allanarse a la pretensión, percibir, ratificar los actos jurídicos procesales suscritos con anterioridad al otorgamiento y/o presentación del presente poder, sustituir o delegar la representación procesal y los demás actos que exprese la ley, con todas las demás facultades que resulten necesarias; llenar cualesquiera otros requisitos y tomar, en fin, todas las medidas que creyeren conducentes al resguardo de nuestros intereses.

Takuya Kakuta

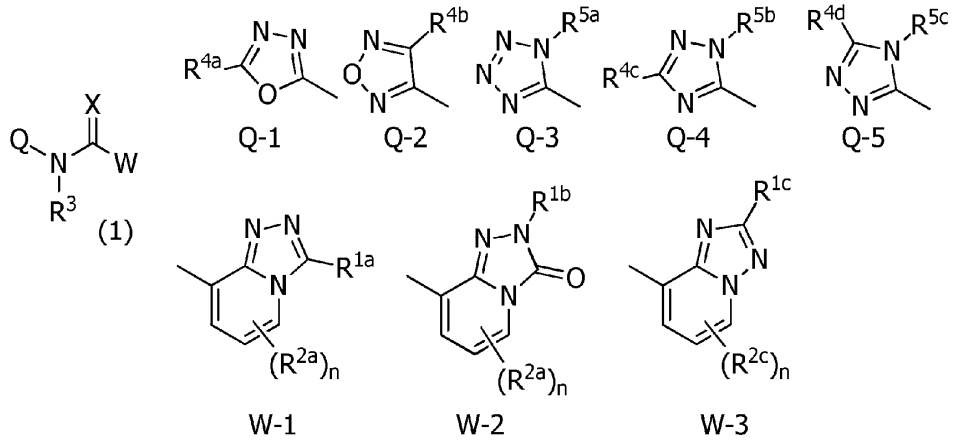
Signature/Firma: Takuya KAKUTA, Senior Managing Associate Executive Officer, Head of Intellectual Property Department.

Date/Fecha: November 25, 2015

City,Country/Ciudad,País: Tokyo, JAPAN

RESUMEN

La presente invención proporciona un compuesto de amida heterocíclica de fórmula (1) y un producto químico agrícola, particularmente un herbicida que contiene:



Donde Q es un heterociclo aromático de cualquiera de Q-1 a Q-5;

W es un heterociclo aromático de W-1, W-2 o W-3;

X es un átomo de oxígeno, etc.,

R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, o alquiloC1-6, etc.,

R^{1b} es un átomo de hidrógeno,

$R^{c\,1}$ alquiloC1-6,

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, etc.,

$R^{2\,c}$ es haloalquilo C_{1-6},

R^3 es un átomo de hidrógeno, etc.,

R^{4a}, R^{4b}, $R^{4\,c}$ y $^{4\,d}$ de R son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6, etc.,

R^{5a}, R^{5b} y $R^{c\,5}$ son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, o alquiloC1-6, etc.,

y n es un entero de 0, 1, 2 o 3.

anhidro y el solvente se separo por destilación bajo presión reducida. El sólido obtenido se purificó mediante recristalización a partir de acetato de etilo para proporcionar 67 mg del producto diana como un sólido amarillo claro.

[3-alil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[l,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida/ N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida = 4/1].

^{1}H NMR de 3-alil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[l,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 12.9 (brs, 1H), 8.42 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.63 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.38-6.24 (m, 1H), 5.36-5.23 (m, 2H), 4.03 (dd, 2H, J=6.9Hz, 1.2Hz), 2.59 (s, 3H).

^{1}H NMR de N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 12.9 (brs, 1H), 8.38 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.60 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.12-7.00 (m, 1H), 6.69-6.62 (m, 1H), 2.60 (s, 3H), 2.09 (dd, 3H, J=6.6Hz, 1.8Hz).

Punto de fusión: 159°C a 161°C

[Ejemplo de Síntesis 11]

3-Alil-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida y N-(1-metil-1H-terazol-5-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida (compuesto No. 2-105 y compuesto No. 2-105 *)

A la solución mixta de 100 mg (0.37 mmol) de la mezcla de ácido 3-alil-5-(trifluorometil) -[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico y ácido 3-(prop-1-en-1-il) -5- (trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico sintetizado en el Paso 2 del Ejemplo de Síntesis 7, 56 mg (0.57 mmol) de 1-metil-1H- tetrazol-5-amina, y 2 ml de piridina, se añadió 66 mg (0.55 mmol) de cloruro de tionilo a una temperatura de 15 °C o inferior. Después de terminar la adición, la temperatura de la solución de reacción se mantuvo a 15°C o menos y se agitó durante 1.5 horas. Después terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. Al residuo obtenido, se añadió1.5 ml de acetonitrilo y 2 ml de ácido clorhídrico 1 mol / L y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (10 ml, 2 veces). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con acetato de etilo y se filtró para proporcionar 27 mg del producto diana como un sólido

de color marrón claro. [3-alil-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida/N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[l, 2,4] triazolo [4,3-a] piridina-8-carboxamida = 3/1].

^{1}H NMR de 3-alil-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 12.5 (brs, 1H), 8.40 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.65 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.37-6.24 (m, 1H), 5.37-5.24 (m, 2H), 4.13 (s, 3H), 4.06 (dd, 2H, J=6.6Hz, 1.2Hz).

^{1}H NMR de N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[l,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 12.5 (brs, 1H),8.36 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.62 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.13-7.01 (m, 1H), 6.70-6.62 (m, 1H), 4.13 (s, 3H), 2.10 (dd, 3H, J=6.6Hz, 1.5Hz).

Punto de fusión: 164°C a 167°C

[Ejemplo de Síntesis 12]

3-(2,2-dicloro-1-metilciclopropil)-N-etil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida (compuesto No. 1-174)

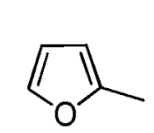
A 1 ml de solución de N,N-dimetilformamida de 67 mg de 3-(2,2-dicloro-1-metilciclopropil)-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida, se añadió 31 mg de carbonato de potasio y 48 mg de yoduro de etilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó a 55° C durante 30 minutos. Después de terminar la reacción, se añadió 2 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (3 ml, 2 vez). La fase orgánica obtenida se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de magnesio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El residuo obtenido se purificó con cromatografía líquida preparativa de presión media eluyendo el residuo con acetato de n-hexano-etilo (gradiente de 2:1 a 0:1) para proporcionar 21 mg del producto diana como una sustancia resinosa incolora.

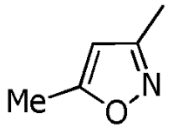
^{1}H NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 7.72 (d, 1H, J=7.8Hz), 7.53 (d, 1H, J=7.8Hz), 4.15 (q, 2H, J=7.2Hz), 2.78 (d, 1H, J=7.8Hz), 2.38 (s, 3H), 1.83 (d, 1H, J=7.8Hz), 1.80 (s, 3H), 1.43 (t, 3H, J=7.2Hz).

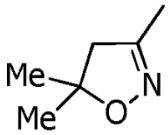
El compuesto de la presente invención se puede sintetizar de acuerdo con los Ejemplos de Síntesis descritos anteriormente. Ejemplos de los compuestos de la presente invención producidos en los métodos similares al Ejemplo de Síntesis 1 a Ejemplo de Síntesis 9 se listan en la cuarta

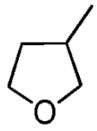
Tabla a décima Tabla. La presente invención, sin embargo, no se limita a estos ejemplos. En las Tablas, Me es un grupo metilo. Del mismo modo, Et es un grupo etilo, Pr es un grupo propilo, Pen es un grupo pentilo, Hex es un grupo hexilo, Ph es un grupo fenilo, Bn es un grupo bencilo, i- es iso, c- es ciclo, y t es terciario.

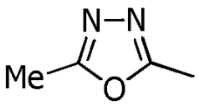
Los sustituyentes de D-2, D-3a, D-4a, D-5, D-6a, D-7a, D-8a, D-9, D-9a, D-9b, D-10a, D-11, D-12, D-13a, D-14, D-15, D-16a, D-16m, D-17, D-17a, D-17b, D-18, D-19, D-20a, D-23a, y D-24f En las tablas son las siguientes estructuras:

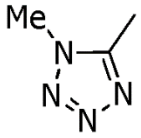

D-2

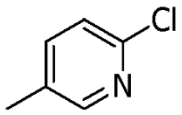

D-3a

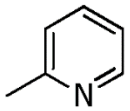

D-4a

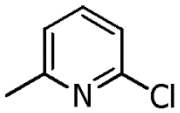

D-5

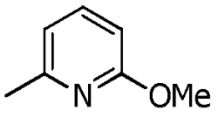

D-6a

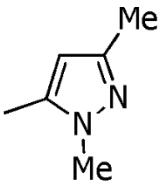

D-7a

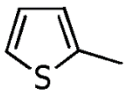

D-8a

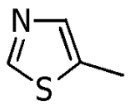

D-9

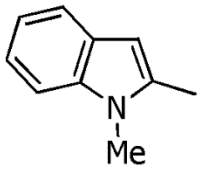

D-9a

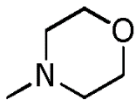

D-9b

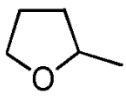

D-10a

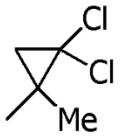

D-11

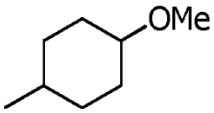

D-12

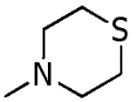

D-13a

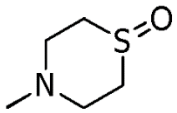

D-14

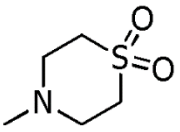

D-15

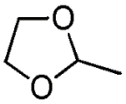

D-16a

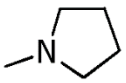

D-16m

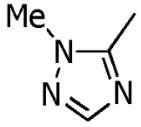

D-17

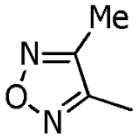

D-17a

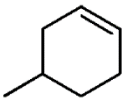

D-17b


D-18


D-19


D-20a

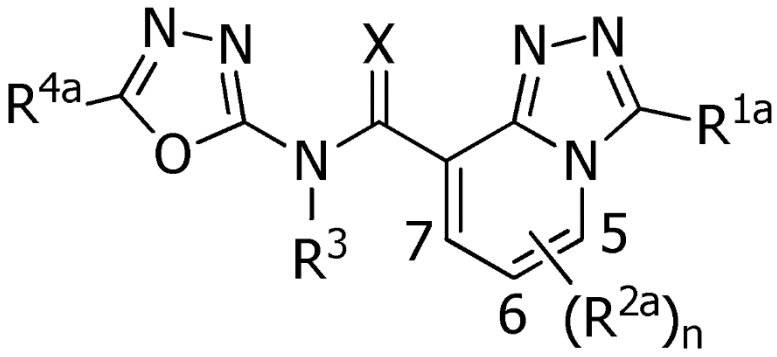

D-23a


D-24f

En las tablas "*1" es "Resinoso". "*2" significa que la descomposición fue observada al momento de la medida del punto de fusión. "*3" es una mezcla de los compuestos 1-158 y 1-158* ode la presente invención y son isómeros que tienen estructuras diferentes y la proporción de ambas 1-

158/1-158* equivale a 9/1. Como se describe en el ejemplo de síntesis 10, "*4" es la mezcla de los compuestos 1-159 y 1-159* de la presente invención, que son isómeros que tienen estructuras diferentes y la proporción de las mismas 1-159/1-159* equivale a 4/1. Como se describe en el ejemplo de síntesis11, "*5" es la mezcla de los compuestos 2-105 y 2-105* de la presente invención que son isómeros que tienen estructuras diferentes y la proporción de las mismas 2-105/2-105* equivale a 3/1.

[0249] [Cuarta Tabla]



[Tabla 27]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{4a}	Punto de fusión (°C)
1-001	H	5-CF_3	O	H	Me	220-223
1-002	Me	5-CF_3	O	H	Me	242-245
1-003	i-Pr	5-Me	O	H	Me	*2
1-004	i-Pr	5-CF_3	O	H	Me	176-178
1-005	i-Pr	5-CF_3	O	H	Et	176-180
1-006	i-Pr	5-CF_3	O	H	Bn	141-150
1-007	i-Pr	5-CF_3	O	H	Ph	173-177
1-008	i-Pr	5-CF_3	O	H	D-2	152-156
1-009	i-Pr	5-SMe	O	H	Me	*2
1-010	c-Pr	5-CF_3	O	H	Me	157-165
1-011	3-Pen	5-CF_3	O	H	Me	171-174
1-012	Ph	5-CF_3	O	H	Me	266-270
1-013	Cl	5-CF_3	O	H	Me	238-241
1-014	Br	5-CF_3	O	H	Me	252-260
1-015	CH_2OMe	5-CF_3	O	H	Me	115-125
1-016	4-MeO-Ph	5-CF_3	O	H	Me	205-208
1-017	4-Cl-Ph	5-CF_3	O	H	Me	256-258
1-018	SMe	5-CF_3	O	H	Me	230-233
1-019	$CH_2O(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	90-91
1-020	$CH_2OCH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	148-149
1-021	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	160-162
1-022	D-3a	5-CF_3	O	H	Me	218-221
1-023	i-Pr	6-CF_3	O	H	Me	160-162
1-024	n-Pr	5-CF_3	O	H	Me	172-176
1-025	CH_2OPh	5-CF_3	O	H	Me	188-190
1-026	c-Pen	5-CF_3	O	H	Me	170-171
1-027	CH_2OEt	5-CF_3	O	H	Me	141-143
1-028	tBu	5-CF_3	O	H	Me	161-165
1-029	D-4a	5-CF_3	O	H	Me	172-176
1-030	CH_2SMe	5-CF_3	O	H	Me	153-155
1-031	$CH_2SCH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	162-163
1-032	SEt	5-CF_3	O	H	Me	182-184
1-033	$SCH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	186-188
1-034	S(O)Et	5-CF_3	O	H	Me	192-193
1-035	$S(O)CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	153-157
1-036	$CH_2S(O)Me$	5-CF_3	O	H	Me	190-191
1-037	$CH_2S(O)_2Me$	5-CF_3	O	H	Me	*1
1-038	$CH_2S(O)CH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	200-202
1-039	$CH_2S(O)_2CH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	*1
1-040	$S(O)_2Me$	5-CF_3	O	H	Me	*1
1-041	$S(O)_2Et$	5-CF_3	O	H	Me	*1
1-042	$CH_2C(O)OEt$	5-CF_3	O	H	Me	187-189
1-043	4-Me-Ph	5-CF_3	O	H	Me	221-223
1-044	4-F-Ph	5-CF_3	O	H	Me	203-208
1-045	4-CF_3-Ph	5-CF_3	O	H	Me	196-198
1-046	3-MeO-Ph	5-CF_3	O	H	Me	178-182
1-047	2-MeO-Ph	5-CF_3	O	H	Me	180-185
1-048	$CH_2C(O)OH$	5-CF_3	O	H	Me	139-141

[Tabla 28]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{4a}	Punto de fusión (°C)
1-049	$CH_2C(O)OCH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	157-159
1-050	i-Pr	5-CF_3	O	H	H	171-175
1-051	i-Pr	5-CF_3	O	H	c-Pr	161-162
1-052	i-Pr	5-CF_3	O	H	$(CH_2)_2OMe$	125-135
1-053	i-Pr	5-CF_2H	O	H	Me	160-162
1-054	D-8a	5-CF_3	O	H	Me	240-243
1-055	D-9a	5-CF_3	O	H	Me	205-208
1-056	D-10a	5-CF_3	O	H	Me	274-275
1-057	D-11	5-CF_3	O	H	Me	222-224
1-058	D-12	5-CF_3	O	H	Me	213-216
1-059	D-13a	5-CF_3	O	H	Me	272-274
1-060	$CH_2C(O)O(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	152-153
1-061	$CH_2C(O)NHCH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	222-227
1-062	$CH_2OC(O)Me$	5-CF_3	O	H	Me	165-167
1-063	$S(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	99-101
1-064	$SCH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	213-217
1-065	$SCH_2C\equiv CH$	5-CF_3	O	H	Me	114-117
1-066	i-Pr	5-CF_2CF_3	O	H	Me	193-195
1-067	CH_2OH	5-CF_3	O	H	Me	236-238
1-068	CHO	5-CF_3	O	H	Me	222-223
1-069	CH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	172-174
1-070	3,5-$(MeO)_2$-Ph	5-CF_3	O	H	Me	228-229
1-071	3,5-$(Cl)_2$-Ph	5-CF_3	O	H	Me	254-256
1-072	CH=NOMe	5-CF_3	O	H	Me	204-207
1-073	$S(O)(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	199-201
1-074	$S(O)CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	134-137
1-075	i-Pr	5-CF_3-6-Me	O	H	Me	168-169
1-076	NMe_2	5-CF_3	O	H	Me	184-185
1-077	$S(O)CH_2C\equiv CH$	5-CF_3	O	H	Me	205-212
1-078	CH(Me)SMe	5-CF_3	O	H	Me	137-139
1-079	CH(Me)S(O)Me	5-CF_3	O	H	Me	127-129
1-080	$CH(Me)S(O)_2Me$	5-CF_3	O	H	Me	159-160
1-081	i-Pr	5-Ph	O	H	Me	131-133
1-082	NHPh	5-CF_3	O	H	Me	179-182
1-083	$(CH_2)_2SMe$	5-CF_3	O	H	Me	157-159
1-084	$(CH_2)_2S(O)Me$	5-CF_3	O	H	Me	179-181
1-085	$(CH_2)_2S(O)_2Me$	5-CF_3	O	H	Me	191-192
1-086	N(Me)Ph	5-CF_3	O	H	Me	175-178
1-087	$S(CH_2)_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	141-142
1-088	i-Pr	5-{3,5-$(F)_2$-Ph}	O	H	Me	191-193
1-089	i-Pr	5-CF_3-7-Me	O	H	Me	120-124
1-090	$NHCH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	163-164
1-091	$SCH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	H	211-213
1-092	$S(O)(CH_2)_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	193-195
1-093	$SCH_2CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	143-145
1-094	$SCH(CH_3)CH_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	150-153
1-095	$SC(CH_3)_3$	5-CF_3	O	H	Me	178-180
1-096	D-14	5-CF_3	O	H	Me	166-168

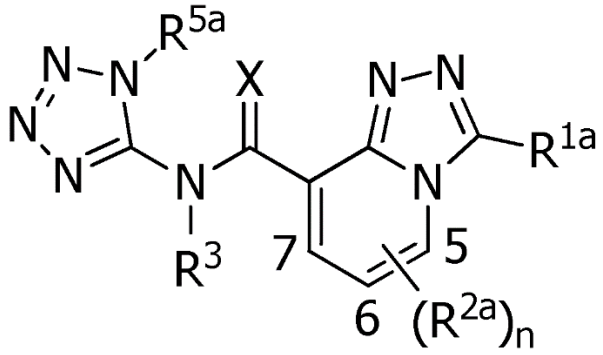
[Tabla 29]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{4a}	Punto de fusión (°C)
1-097	i-Pr	5-CF_3	O	H	D-15	108-111
1-098	i-Pr	5-CF_3	O	H	D-14	*1
1-099	i-Pr	5-CF_3	O	H	4-MeO-Ph	154-158
1-100	i-Pr	5-CF_3	O	H	CF_3	111-116
1-101	i-Pr	5-CF_3	O	H	D-9	167-169
1-102	NH(D-9b)	5-CF_3	O	H	Me	219-221
1-103	NMe_2	5-CF_3	O	H	H	200-205
1-104	CH_2(c-Pr)	5-CF_3	O	H	Me	160-163
1-105	D-16a	5-CF_3	O	H	Me	232-235
1-106	SEt	5-CF_3	O	H	H	189-191
1-107	$CH_2O(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	H	117-118
1-108	$S(CH_2)_2CH_3$	5-CF_3	O	H	H	198-200
1-109	$NH(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	150-155
1-110	D-14	5-CF_3	O	H	H	180-182
1-111	$NHS(O)_2Ph$	5-CF_3	O	H	Me	259-261
1-112	OEt	5-CF_3	O	H	H	135-145
1-113	SCH_2Ph	5-CF_3	O	H	Me	187-190
1-114	SCH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	155-158
1-115	SCH_2(c-Pr)	5-CF_3	O	H	Me	135-137
1-116	SCH_2(D-15)	5-CF_3	O	H	Me	142-143
1-117	SCH_2CN	5-CF_3	O	H	Me	179-182
1-118	D-17	5-CF_3	O	H	Me	*1
1-119	D-17a	5-CF_3	O	H	Me	250-255
1-120	D-17b	5-CF_3	O	H	Me	235-238
1-121	$N(Me)(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	H	131-134
1-122	$N(Me)CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	H	155-157
1-123	N(Me)(c-Hex)	5-CF_3	O	H	H	64-66
1-124	SCH_2CF_3	5-CF_3	O	H	Me	156-157
1-125	$SCH_2C(O)CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	178-182
1-126	SCH_2(D-18)	5-CF_3	O	H	Me	200-203
1-127	$SCH_2C(O)OMe$	5-CF_3	O	H	Me	184-185
1-128	$SCH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	H	188-190
1-129	$N(Me)(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	75-80
1-130	$NH(CH_2)_2SMe$	5-CF_3	O	H	Me	111-115
1-131	$NHCH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	140-144
1-132	$N(Me)CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	164-168
1-133	N(Me)(c-Hex)	5-CF_3	O	H	Me	135-140
1-134	N(Me)Et	5-CF_3	O	H	Me	125-128
1-135	$N(Et)_2$	5-CF_3	O	H	Me	135-137
1-136	D-19	5-CF_3	O	H	Me	151-152
1-137	N(Me)Et	5-CF_3	O	H	H	141-143
1-138	$N(Et)_2$	5-CF_3	O	H	H	130-131
1-139	D-19	5-CF_3	O	H	H	217-218
1-140	i-Pr	5-CF_3	O	H	D-11	200-201
1-141	i-Pr	5-CF_3	O	H	CH_2SMe	114-116
1-142	i-Pr	5-CF_3	O	H	$CH_2S(O)_2Me$	171-173
1-143	i-Pr	5-CF_3	O	H	$CH_2S(O)Me$	149-150
1-144	c-Pr	5-CF_3	O	H	H	170-174

[Tabla 30]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{4a}	Punto de fusión (°C)
1-145	3-Pen	5-CF_3	O	H	H	228-231
1-146	CH_2SMe	5-CF_3	O	H	H	176-179
1-147	4-F-Ph	5-CF_3	O	H	H	222-226
1-148	3,5-$(MeO)_2$-Ph	5-CF_3	O	H	H	217-220
1-149	4-MeO-Ph	5-CF_3	O	H	H	210-213
1-150	D-8a	5-CF_3	O	H	H	244-248
1-151	CH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	H	187-190
1-152	N(Me)$CH_2C\equiv CH$	5-CF_3	O	H	Me	161-163
1-153	N(Me)$(CH_2)_2CN$	5-CF_3	O	H	Me	138-143
1-154	S(c-Pen)	5-CF_3	O	H	Me	153-155
1-155	S(c-Pen)	5-CF_3	O	H	H	214-216
1-156	SCH_2(D-8a)	5-CF_3	O	H	Me	171-172
1-157	SCH_2(D-8a)	5-CF_3	O	H	H	204-207
1-158	$CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	H	155-158(*3)
1-158*	CH=CHMe	5-CF_3	O	H	H	155-158(*3)
1-159	$CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	159-161(*4)
1-159*	CH=CHMe	5-CF_3	O	H	Me	159-161(*4)
1-160	$C\equiv CMe$	5-CF_3	O	H	H	*2
1-161	$C\equiv CMe$	5-CF_3	O	H	Me	>280
1-162	CH_2CF_3	5-CF_3	O	H	Me	199-203
1-163	N(Me)$CH_2C\equiv CH$	5-CF_3	O	H	H	216-218
1-164	N(Me)$(CH_2)_2CN$	5-CF_3	O	H	H	105-110
1-165	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	136-139
1-166	N(Me)$CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	127-129
1-167	N(Me)CH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	191-194
1-168	CH_2CN	5-CF_3	O	H	Me	196-199
1-169	D-16m	5-CF_3	O	H	Me	146-147
1-170	D-24f	5-CF_3	O	H	Me	182-185
1-171	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	H	180-185
1-172	N(Me)$CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	H	135-137
1-173	$(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	157-158
1-174	D-16a	5-CF_3	O	Et	Me	*1

[0250] [Quinta Tabla]



[Tabla 31]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{5a}	Punto de fusión (°C)
2-001	H	5-CF_3	O	H	Me	247-251
2-002	Me	5-CF_3	O	H	Me	215-219
2-003	i-Pr	5-CF_3	O	H	Me	215-220
2-004	i-Pr	5-Cl	O	H	Me	189-190
2-005	c-Pr	5-CF_3	O	H	Me	190-195
2-006	3-Pen	5-CF_3	O	H	Me	143-144
2-007	Ph	5-CF_3	O	H	Me	245-247
2-008	Cl	5-CF_3	O	H	Me	193-195
2-009	Br	5-CF_3	O	H	Me	186-193
2-010	CH_2OMe	5-CF_3	O	H	Me	205-209
2-011	4-MeO-Ph	5-CF_3	O	H	Me	173-177
2-012	4-Cl-Ph	5-CF_3	O	H	Me	256-258
2-013	SMe	5-CF_3	O	H	Me	210-215
2-014	$CH_2O(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	152-154
2-015	$CH_2OCH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	170-171
2-016	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	181-184
2-017	D-3a	5-CF_3	O	H	Me	251-253
2-018	i-Pr	6-CF_3	O	H	Me	169-171
2-019	n-Pr	5-CF_3	O	H	Me	149-150
2-020	CH_2OPh	5-CF_3	O	H	Me	116-117
2-021	c-Pen	5-CF_3	O	H	Me	197-201
2-022	D-5	5-CF_3	O	H	Me	147-149
2-023	i-Pr	5-CF_3	O	Me	Me	215-216
2-024	SEt	5-CF_3	O	H	Me	157-159
2-025	$SCH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	200-204
2-026	CH_2OEt	5-CF_3	O	H	Me	183-184
2-027	tBu	5-CF_3	O	H	Me	217-218
2-028	D-4a	5-CF_3	O	H	Me	186-188
2-029	CH_2SMe	5-CF_3	O	H	Me	189-191
2-030	$CH_2SCH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	155-158
2-031	S(O)Et	5-CF_3	O	H	Me	190-191
2-032	$S(O)CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	163-167
2-033	$CH_2S(O)Me$	5-CF_3	O	H	Me	204-206
2-034	$CH_2S(O)_2Me$	5-CF_3	O	H	Me	212-214
2-035	$CH_2S(O)CH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	138-142
2-036	$CH_2S(O)_2CH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	176-178
2-037	$S(O)_2Me$	5-CF_3	O	H	Me	*1
2-038	$S(O)_2Et$	5-CF_3	O	H	Me	*1
2-039	i-Pr	5-CF_3	S	H	Me	198-200
2-040	$CH_2C(O)OEt$	5-CF_3	O	H	Me	202-204
2-041	i-Pr	5-CF_3	O	H	CH_2CH_2OMe	*1
2-042	4-Me-Ph	5-CF_3	O	H	Me	221-225
2-043	4-F-Ph	5-CF_3	O	H	Me	236-240
2-044	3-MeO-Ph	5-CF_3	O	H	Me	210-212
2-045	2-MeO-Ph	5-CF_3	O	H	Me	150-153
2-046	i-Pr	5-CF_3	O	H	$CH_2C(O)OMe$	149-154
2-047	i-Pr	5-CF_2H	O	H	Me	172-173
2-048	i-Pr	5-CF_3	O	H	CH_2CH_2SMe	*1

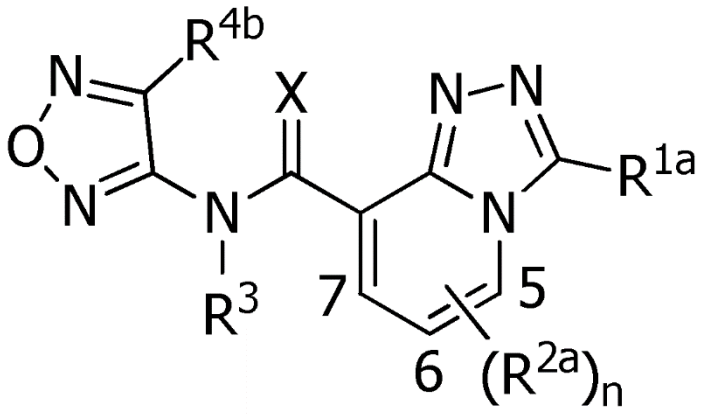
[Tabla 32]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{5a}	Punto de fusión (°C)
2-049	i-Pr	5-CF_2CF_3	O	H	Me	240-241
2-050	i-Pr	5-CF_3-6-Me	O	H	Me	208-209
2-051	NMe_2	5-CF_3	O	H	Me	222-225
2-052	CH(Me)SMe	5-CF_3	O	H	Me	202-204
2-053	CH(Me)S(O)Me	5-CF_3	O	H	Me	150-152
2-054	CH(Me)$S(O)_2$Me	5-CF_3	O	H	Me	117-125
2-055	i-Pr	5-Ph	O	H	Me	193-198
2-056	NHPh	5-CF_3	O	H	Me	255-260
2-057	$(CH_2)_2$SMe	5-CF_3	O	H	Me	144-146
2-058	$(CH_2)_2$S(O)Me	5-CF_3	O	H	Me	96-102
2-059	$(CH_2)_2S(O)_2$Me	5-CF_3	O	H	Me	173-175
2-060	D-8a	5-CF_3	O	H	Me	217-220
2-061	D-11	5-CF_3	O	H	Me	223-224
2-062	D-10a	5-CF_3	O	H	Me	246-248
2-063	3,5-$(MeO)_2$-Ph	5-CF_3	O	H	Me	197-199
2-064	3,5-$(Cl)_2$-Ph	5-CF_3	O	H	Me	269-271
2-065	CH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	167-168
2-066	NHCH$(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	104-107
2-067	S(O)Me	5-CF_3	O	H	Me	228-229
2-068	S$(CH_2)_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	136-138
2-069	S(O)$(CH_2)_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	155-157
2-070	$S(O)_2(CH_2)_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	203-205
2-071	$SCH_2CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	159-160
2-072	SCH$(CH_3)CH_2CH_3$	5-CF_3	O	H	Me	170-173
2-073	i-Pr	5-CF_3	O	H	Ph	133-136
2-074	NH$(CH_2)_2$OMe	5-CF_3	O	H	Me	111-115
2-075	D-14	5-CF_3	O	H	Me	240-245
2-076	SCH_2Ph	5-CF_3	O	H	Me	179-181
2-077	SCH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	190-192
2-078	D-17	5-CF_3	O	H	Me	285-290
2-079	N(Me)$(CH_2)_2$OMe	5-CF_3	O	H	Me	168-169
2-080	NH$(CH_2)_2$SMe	5-CF_3	O	H	Me	*1
2-081	$NHCH_2CF_3$	5-CF_3	O	H	Me	*1
2-082	N(Me)CH$(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	171-172
2-083	N(Me)(c-Hex)	5-CF_3	O	H	Me	144-145
2-084	SCH_2(c-Pr)	5-CF_3	O	H	Me	168-169
2-085	SCH_2(D-15)	5-CF_3	O	H	Me	139-141
2-086	SCH_2CN	5-CF_3	O	H	Me	144-145
2-087	SCH_2CF_3	5-CF_3	O	H	Me	160-161
2-088	N(Me)Et	5-CF_3	O	H	Me	110-112
2-089	$N(Et)_2$	5-CF_3	O	H	Me	159-160
2-090	i-Pr	5-CF_3	O	H	n-Pr	111-112
2-091	i-Pr	5-CF_3	O	H	$CH_2CH=CH_2$	118-119
2-092	i-Pr	5-CF_3	O	H	$CH_2C(O)OEt$	104-105
2-093	i-Pr	5-CF_3	O	H	CH_2(4-Cl-Ph)	147-148
2-094	N(Me)$CH_2C\equiv CH$	5-CF_3	O	H	Me	176-178
2-095	N(Me)$(CH_2)_2CN$	5-CF_3	O	H	Me	125-128
2-096	S(c-Pen)	5-CF_3	O	H	Me	192-194

[Tabla 33]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{5a}	Punto de fusión (°C)
2-097	SCH_2(D-8a)	5-CF_3	O	H	Me	175-178
2-098	SEt	5-CF_3	O	H	CH_2CH_2OMe	130-131
2-099	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF_3	O	H	Me	141-142
2-100	N(Me)$CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	183-184
2-101	S$(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	O	H	Me	144-145
2-102	$SCH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	172-174
2-103	$SCH_2C\equiv CH$	5-CF_3	O	H	Me	190-191
2-104	i-Pr	5-CF_3	O	H	H	276-280
2-105	$CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	O	H	Me	164-167(*5)
2-105*	CH=CHMe	5-CF_3	O	H	Me	164-167(*5)
2-106	$C\equiv CMe$	5-CF_3	O	H	Me	244-246
2-107	$CH_2OC(O)Me$	5-CF_3	O	H	Me	176-178
2-108	CH_2OH	5-CF_3	O	H	Me	155-158
2-109	CHO	5-CF_3	O	H	Me	250-252
2-110	D-16a	5-CF_3	O	H	Me	194-201

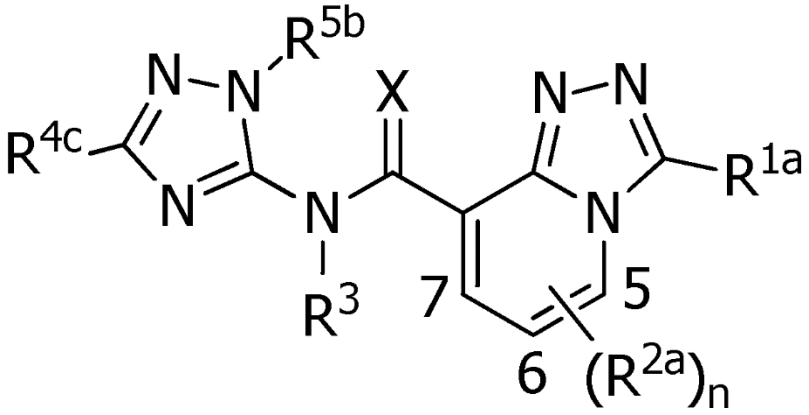
[0251] [Sexta Tabla]



[Tabla 34]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{4b}	Punto de fusión (°C)
3-001	i-Pr	5-CF_3	O	H	Me	185-186
3-002	$SCH_2CH(CH_3)_2$	5-CF_3	O	H	Me	136-137

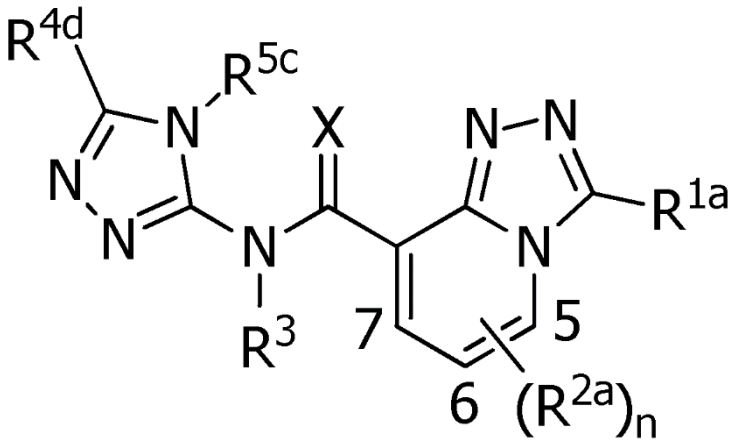
[0252] [Séptima Tabla]



[Tabla 35]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{4c}	R^{5b}	Punto de fusión (°C)
4-001	i-Pr	5-CF_3	O	H	H	Me	182-185
4-002	i-Pr	5-CF_3	O	H	H	Et	*1
4-003	SEt	5-CF_3	O	H	H	Me	119-120
4-004	i-Pr	5-CF_3	O	H	H	H	250-255

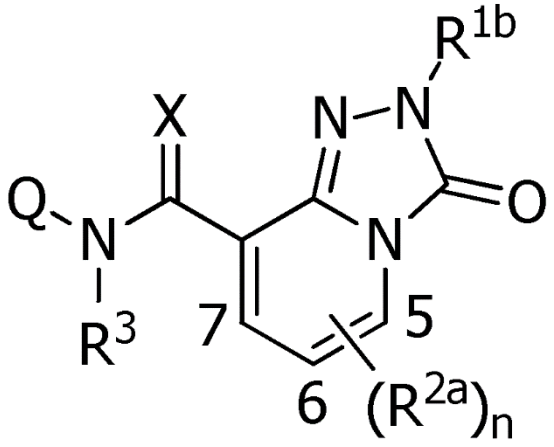
[0253] [Octava Tabla]



[Tabla 36]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	R^{4d}	R^{5c}	Punto de fusión (°C)
5-001	i-Pr	5-CF_3	O	H	Me	Me	215-220
5-002	i-Pr	5-CF_3	O	H	-CH=CH-CH=CH-		219-223
5-003	i-Pr	5-CF_3	O	H	-$(CH_2)_4$-		130-135

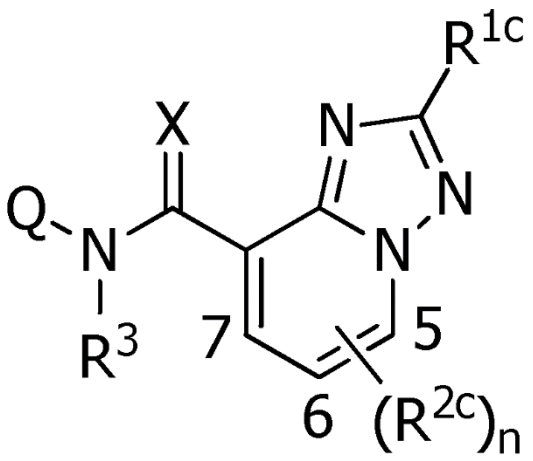
[0254] [Novena Tabla]



[Tabla 37]

No.	Q	R^{1b}	$(R^{2a})_n$	X	R^3	Punto de Fusión (°C)
6-001	D-6a	Me	5-CF_3	O	H	250-260
6-002	D-7a	Me	5-CF_3	O	H	245-246
6-003	D-6a	Et	5-CF_3	O	H	234-236
6-004	D-7a	Et	5-CF_3	O	H	176-178
6-005	D-6a	i-Pr	5-CF_3	O	H	184-190
6-006	D-6a	CH_2Ph	5-CF_3	O	H	155-162
6-007	D-20a	Et	5-CF_3	O	H	182-185
6-008	D-23a	Et	5-CF_3	O	H	162-164

[0255] [Décima Tabla]



[Tabla 38]

No.	Q	R^{1c}	$(R^{2c})_n$	X	R^3	Punto de fusión (°C)
7-001	D-6a	i-Pr	5-CF_3	O	H	252-255
7-002	D-7a	i-Pr	5-CF_3	O	H	168-170

Entre los compuestos de la presente invención, los datos de 1H-NMR de los compuestos que no tienen punto de fusión y las mezclas de isómeros de "*3", "*4", y "*5" se encuentran en la undécima tabla.

Los valores del cambio químico de la resonancia magnética nuclear del protón fueron medidos en solvente deuterado de cloroformo a 300MHZ usando Me_4Si (tetrametilsilano) como patrón. Los símbolos en la cuarta tabla tienen los siguientes significados s: singulete, Bfs: singulete ancho, d: doblete, dd: doble doblete, t: triplete, q: cuarteto, y m: multiplete.

Undécima Tabla

[Tabla 39]

No.	^{1}H-NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz)
1-003	δ 8.21 (d, 1H, J=7.2Hz), 6.77 (d, 1H, J=7.2Hz), 3.85-3.70 (m, 1H), 2.97 (s, 3H), 2.55 (s, 3H), 1.58 (d, 6H, J=7.2Hz)。
1-009	δ 8.24 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.67 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.92 (brs, 1H), 4.25-4.10 (m, 1H), 2.75 (s, 3H), 2.55 (s, 3H), 1.60 (d, 6H, J=6.9Hz)。
1-037	δ 8.51 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.72 (d, 1H, J=6.9Hz), 5.05 (s, 2H), 3.26 (s, 3H), 2.60 (s, 3H)。(No se observa el pico del proton de CONH)
1-039	δ 8.54 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.76 (d, 1H, J=7.5Hz), 5.17 (s, 2H), 4.36 (q, 2H, J=9.0Hz), 2.60 (s, 3H)。(No se observa el pico del proton de CONH)
1-040	δ 8.54 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.79 (d, 1H, J=7.2Hz), 3.78 (s, 3H), 2.60 (s, 3H)。(No se observa el pico del proton de CONH)
1-041	δ 8.53 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.78 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.00 (q, 2H, J=7.5Hz), 2.60 (s, 3H), 1.59(t, 3H, J=7.5Hz)。(No se observa el pico del proton de CONH)
1-098	δ 8.34 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.59 (d, 1H, J=7.5Hz), 3.82 (t, 4H, J=4.9Hz), 3.79-3.68 (m, 1H), 3.54 (t, 4H, J=4.9Hz), 1.56(d, 6H, J=6.5Hz)。 (No se observa el pico del proton de CONH)
1-118	δ 12.68 (brs, 1H), 8.39 (d, 1H, J=7.4Hz), 7.59 (d, 1H, J=7.4Hz), 3.59 -3.39 (m, 4H), 3.05-2.78 (m, 4H), 2.59 (s, 3H)。
1-158	δ 13.1 (brs, 1H), 8.44 (d, 1H, J=7.5Hz), 8.30 (s, 1H), 7.64 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.38-6.25 (m, 1H), 5.38-5.24 (m, 2H), 4.04 (dd, 2H, J=3.9Hz, 1.2Hz)。
1-158*	δ 13.0 (brs, 1H), 8.43 (d, 1H, J=6.6Hz), 8.30 (s, 1H), 7.62 (d, 1H, J=6.6Hz), 7.11-7.01 (m, 1H), 6.71-6.61(m, 1H), 2.10 (d, 3H, J=6.6Hz)。
1-159	δ 12.9 (brs, 1H), 8.42 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.63 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.38-6.24 (m, 1H), 5.36-5.23 (m, 2H), 4.03 (dd, 2H, J=6.9Hz, 1.2Hz), 2.59 (s, 3H)。
1-159*	δ 12.9 (brs, 1H), 8.38 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.60 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.12-7.00 (m, 1H), 6.69-6.62 (m, 1H), 2.60 (s, 3H), 2.09 (dd, 3H, J=6.6Hz, 1.8Hz)。
1-160	δ 12.8 (brs, 1H), 8.46 (d, 1H, J=7.2Hz), 8.31 (s, 1H), 7.65 (d, 1H, J=7.2Hz), 2.27 (s, 3H)。
1-161	δ 12.6 (brs, 1H), 8.44 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.64 (d, 1H, J=7.2Hz), 2.59 (s, 3H), 2.27 (s, 3H)。
1-174	δ 7.72 (d, 1H, J=7.8Hz), 7.53 (d, 1H, J=7.8Hz), 4.15 (q, 2H, J=7.2Hz), 2.78 (d, 1H, J=7.8Hz), 2.38 (s, 3H), 1.83 (d, 1H, J=7.8Hz), 1.80 (s, 3H), 1.43 (t, 3H, J=7.2Hz)。
2-037	δ 12.08 (brs, 1H), 8.62 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.86 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.12 (s, 3H), 3.80 (s, 3H)。
2-038	δ 12.11 (brs, 1H), 8.62 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.86 (d, 1H, J=7.2Hz), 4.12 (s, 3H), 4.01 (q, 2H, J=7.2Hz), 1.60 (t, 3H, J=7.2Hz)。
2-041	δ 12.49 (brs, 1H), 8.35 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.62 (d, 1H, 7.5Hz), 4.65-4.55 (m, 2H), 3.90-3.80 (m, 2H), 3.75-3.65 (m, 1H), 3.38 (s, 3H), 1.60-1.50(m, 6H)。

[Tabla 40]

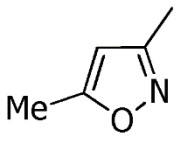
No.	^{1}H-NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz)
2-048	δ 12.6 (brs, 1H), 8.35 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.64 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.60 (t, 2H, J=7.2Hz), 3.80-3.65 (m, 1H), 3.09 (t, 2H, J=7.2Hz), 2.11 (s, 3H), 1.56 (d, 6H, J=6.9Hz)。
2-080	δ 12.4 (brs, 1H), 8.14 (d, 1H, J=6.6Hz), 7.40 (d, 1H, J=6.6Hz), 5.24 (brs, 1H), 4.11 (s, 3H), 3.88-3.80 (m, 2H), 2.99-2.91 (m, 2H), 2.16 (s, 3H)。
2-081	δ 12.3 (brs, 1H), 8.23 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.49 (d, 1H, J=7.2Hz), 4.78 (brs, 1H), 4.45-4.32 (m, 2H), 4.11 (s, 3H)。
2-105	δ 12.5 (brs, 1H), 8.40 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.65 (d, 1H, J=7.5Hz), 6.37-6.24 (m, 1H), 5.37-5.24 (m, 2H), 4.13 (s, 3H), 4.06 (dd, 2H, J=6.6Hz, 1.2Hz)。
2-105*	δ 12.5 (brs, 1H),8.36 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.62 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.13-7.01 (m, 1H), 6.70-6.62 (m, 1H), 4.13 (s, 3H), 2.10 (dd, 3H, J=6.6Hz, 1.5Hz)。
4-002	δ 12.3(brs, 1H), 8.37 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.88(s, 1H), 7.61 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.23 (q, 2H, J=7.5Hz), 3.80-3.60 (m, 1H), 1.60-1.50 (m, 9H)。

[0258] Ejemplo de Referencia

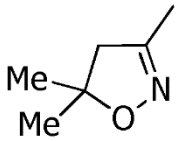
[Ejemplo de Referencia 1]

Los compuestos listados en la duodécima table fueron sintetizados mediante un método similar al método del paso 1 del ejemplo de síntesis 7. En las Tablas, Me es un grupo metilo. similarmente, Et es un grupo etilo, Pr es un grupo propilo, Pen es un grupo pentilo, Ph es un grupo fenilo, Bn es un grupo bencilo, n- es normal, i- es iso, c- es ciclo, y t- es terciario.

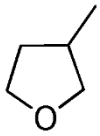
En las tablas, los sustituyentes de D-3a, D-4a, D-5, D-8a, D-9a, D-10a, D-11, D-12, D-13a, D-14, D-16a, y D-16m tiene las siguientes estructuras.



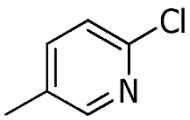
D-3a



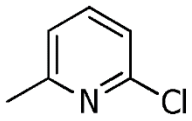
D-4a



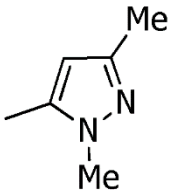
D-5



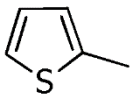
D-8a



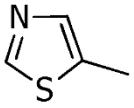
D-9a



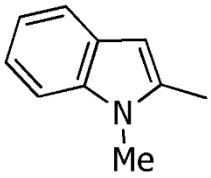
D-10a



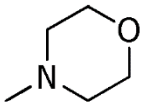
D-11



D-12

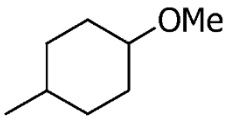


D-13a



D-14

D-16a

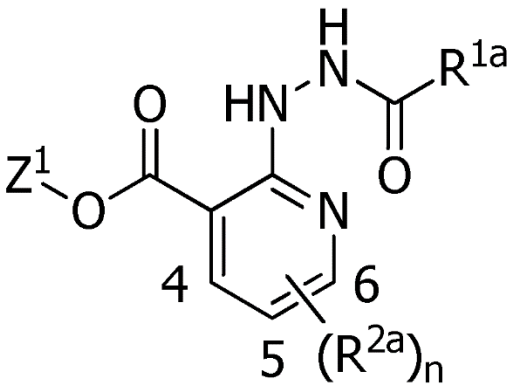


D-16m

[0259] Entre los compuestos de la presente invención, los datos de 1H-NMR de los compuestos que no tienen punto de fusión se encuentran en la decimosexta tabla.

Los valores del cambio químico de la resonancia magnética nuclear del protón fueron medidos en solvente deuterado de cloroformo a 300MHZ usando Me_4Si (tetrametilsilano) como patrón. Los símbolos en la cuarta tabla tienen los siguientes significados s: singulete, Bfs: singulete ancho, d: doblete, dd: doble doblete, t: triplete, q: cuarteto, y m: multiplete.

[0260] [Duodécima Tabla]



[Tabla 41]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})n$	Z^1	Punto de Fusión (°C)
A1-01a	H	6-CF_3	Me	*1
A1-02a	c-Pr	6-CF_3	Me	143-144
A1-03a	3-Pen	6-CF_3	Me	125-126
A1-04a	Ph	6-CF_3	Me	*1
A1-05a	CH_2OMe	6-CF_3	Me	76－77
A1-06a	4-MeO-Ph	6-CF_3	Me	116-120
A1-07a	4-Cl-Ph	6-CF_3	Me	163-165
A1-08a	$CH_2O(CH_2)_2OMe$	6-CF_3	Me	*1
A1-09a	$CH_2OCH_2CF_3$	6-CF_3	Me	82-85
A1-10a	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	6-CF_3	Me	148-149
A1-11a	D-3a	6-CF_3	Me	121-122
A1-12a	i-Pr	5-CF_3	Me	130-131
A1-13a	n-Pr	6-CF_3	Me	119-120
A1-14a	CH_2OPh	6-CF_3	Me	95-97
A1-15a	c-Pen	6-CF_3	Me	158-159
A1-16a	D-5	6-CF_3	Me	155-156
A1-17a	CH_2OEt	6-CF_3	Me	55-57
A1-18a	t-Bu	6-CF_3	Me	144-146
A1-19a	D-4a	6-CF_3	Me	99-100
A1-20a	CH_2SMe	6-CF_3	Me	127-129
A1-21a	$CH_2SCH_2CF_3$	6-CF_3	Me	114-116
A1-22b	$CH_2C(O)OEt$	6-CF_3	Bn	110-112
A1-23a	4-Me-Ph	6-CF_3	Me	183-185
A1-24a	4-F-Ph	6-CF_3	Me	117-119
A1-25a	4-CF_3-Ph	6-CF_3	Me	160-162
A1-26a	3-MeO-Ph	6-CF_3	Me	103-106
A1-27a	2-MeO-Ph	6-CF_3	Me	160-164
A1-28a	i-Pr	6-CF_2H	Me	140-141
A1-29a	D-8a	6-CF_3	Me	172-175
A1-30a	D-9a	6-CF_3	Me	160-170
A1-31a	D-10a	6-CF_3	Me	161-163
A1-32a	D-11	6-CF_3	Me	45-50
A1-33a	D-12	6-CF_3	Me	40-45
A1-34a	D-13a	6-CF_3	Me	183-184
A1-35b	$CH_2OC(O)Me$	6-CF_3	Bn	89-91
A1-36a	CH_2(4-MeO-Ph)	6-CF_3	Me	121-122
A1-37c	i-Pr	6-CF_2CF_3	Et	120-121
A1-38a	3,5-$(MeO)_2$-Ph	6-CF_3	Me	106-107
A1-39a	3,5-$(Cl)_2$-Ph	6-CF_3	Me	178-179
A1-40a	i-Pr	5-Me-6-CF_3	Me	169-174
A1-41c	i-Pr	4-Me-6-CF_3	Et	140-141
A1-42a	$(CH_2)_2SMe$	6-CF_3	Me	90-91
A1-43a	CH(Me)SMe	6-CF_3	Me	166-167
A1-44c	i-Pr	6-Ph	Et	144-146
A1-45c	i-Pr	6-{3,5-$(F)_2$-Ph}	Et	144-146
A1-46a	NMe_2	6-CF_3	Me	134-137
A1-47c	D-14	6-CF_3	Et	101-105
A1-48a	CH_2(c-Pr)	6-CF_3	Me	119-122

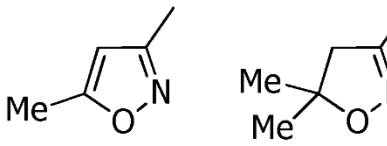
[Tabla 42]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})n$	Z^1	Punto de Fusión (°C)
A1-49a	D-16a	6-CF_3	Me	70-75
A1-50a	C≡CMe	6-CF_3	Me	151-153
A1-51a	CH_2CF_3	6-CF_3	Me	170-172
A1-52a	CH_2CN	6-CF_3	Me	163-165
A1-53c	D-16m	6-CF_3	Et	120-125
A1-55c	$(CH_2)_2OMe$	6-CF_3	Et	96-98

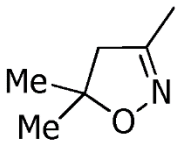
[0261] [Ejemplo de Referencia 2]

Los compuestos listados en la decimotercera table fueron sintetizados mediante un método similar al método del paso 2 del ejemplo de síntesis 7. En las Tablas, Me es un grupo metilo. Similarmente, Et es un grupo etilo, Pr es un grupo propilo, Pen es un grupo pentilo, Ph es un grupo fenilo, Bn es un grupo bencilo, n- es normal, i- es iso, c- es ciclo, y t- es terciario.

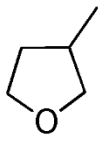
EN las tablas, los sustituyentes de D-3a, D-4a, D-5, D-8a, D-9a, D-10a, D-11, D-12, D-13a, D-14, D-16a, D-16m y D-24f tienen las siguietes estructuras.



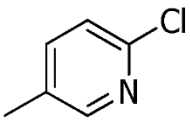
D-3a



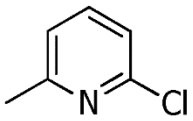
D-4a



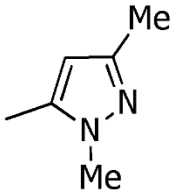
D-5



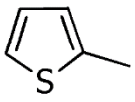
D-8a



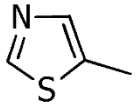
D-9a



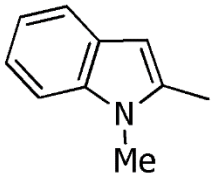
D-10a



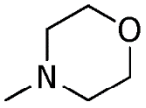
D-11



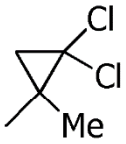
D-12



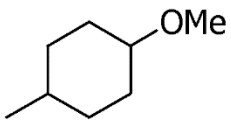
D-13a



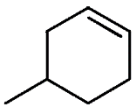
D-14



D-16a



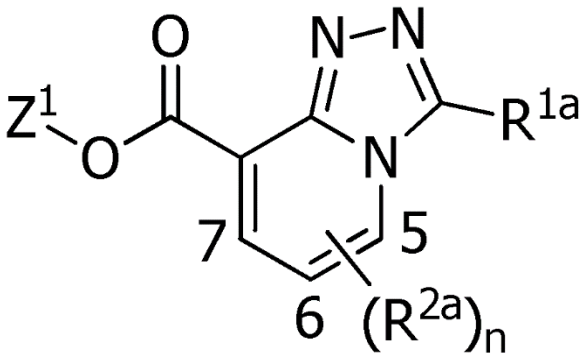
D-16m



D-24f

[0262] En las Tablas, "*1" es "Resinoso". Los datos de ^{1}H-NMR de los compuestos que no tienen punto de fusión están registrados en la decimosexta tabla.

[0263] [Decimotercera Tabla]



[Tabla 43]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})n$	Z^1	Punto de Fusión (°C)
B1-01a	H	5-CF_3	Me	*1
B1-02a	c-Pr	5-CF_3	Me	*1
B1-04a	Ph	5-CF_3	Me	*1
B1-05a	CH_2OMe	5-CF_3	Me	95－97
B1-06a	4-MeO-Ph	5-CF_3	Me	160-162
B1-07a	4-Cl-Ph	5-CF_3	Me	148-152
B1-08a	$CH_2O(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	Me	*1
B1-09a	$CH_2OCH_2CF_3$	5-CF_3	Me	87-89
B1-10a	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	5-CF_3	Me	86-94
B1-11a	D-3a	5-CF_3	Me	140-141
B1-12a	i-Pr	6-CF_3	Me	105-107
B1-13a	n-Pr	5-CF_3	Me	129-130
B1-14a	CH_2OPh	5-CF_3	Me	102-103
B1-15a	c-Pen	5-CF_3	Me	130-134
B1-17a	CH_2OEt	5-CF_3	Me	87-89
B1-18a	t-Bu	5-CF_3	Me	75-77
B1-19a	D-4a	5-CF_3	Me	137-139
B1-20a	CH_2SMe	5-CF_3	Me	97-99
B1-21a	$CH_2SCH_2CF_3$	5-CF_3	Me	125-126
B1-22b	$CH_2C(O)OEt$	5-CF_3	Bn	72-73
B1-23a	4-Me-Ph	5-CF_3	Me	142-145
B1-24a	4-F-Ph	5-CF_3	Me	133-135
B1-25a	4-CF_3-Ph	5-CF_3	Me	170-171
B1-26a	3-MeO-Ph	5-CF_3	Me	135-142
B1-27a	2-MeO-Ph	5-CF_3	Me	*1
B1-28a	i-Pr	5-CF_2H	Me	142-145
B1-29a	D-8a	5-CF_3	Me	*1
B1-30a	D-9a	5-CF_3	Me	140-145
B1-31a	D-10a	5-CF_3	Me	126-129
B1-32a	D-11	5-CF_3	Me	122-124
B1-33a	D-12	5-CF_3	Me	171-172
B1-34a	D-13a	5-CF_3	Me	*1
B1-35b	$CH_2OC(O)Me$	5-CF_3	Bn	88-89
B1-36a	CH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	Me	92-110
B1-37c	i-Pr	5-CF_2CF_3	Et	57-58
B1-38a	3,5-$(MeO)_2$-Ph	5-CF_3	Me	150-161
B1-39a	3,5-$(Cl)_2$-Ph	5-CF_3	Me	157-164
B1-40a	i-Pr	5-CF_3-6-Me	Me	58-59
B1-41c	i-Pr	5-CF_3-7-Me	Et	76-77
B1-42a	$(CH_2)_2SMe$	5-CF_3	Me	126-127
B1-43a	CH(Me)SMe	5-CF_3	Me	103-104
B1-44c	i-Pr	5-Ph	Et	133-134
B1-45c	i-Pr	5-{3,5-$(F)_2$-Ph}	Et	125-127
B1-46a	NMe_2	5-CF_3	Me	135-137
B1-47c	D-14	5-CF_3	Et	138-139
B1-48a	CH_2(c-Pr)	5-CF_3	Me	130-135
B1-49a	D-16a	5-CF_3	Me	*1
B1-50a	C≡CMe	5-CF_3	Me	163-168

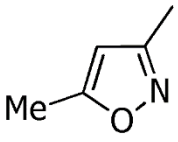
[Tabla 44]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})n$	Z^1	Punto de Fusión (°C)
B1-51a	CH_2CF_3	5-CF_3	Me	150-154
B1-52a	CH_2CN	5-CF_3	Me	165-170
B1-53c	D-16m	5-CF_3	Et	95-102
B1-54c	D-24f	5-CF_3	Et	101-110
B1-55c	$(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	Et	82-83

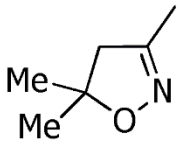
[0264] [Ejemplo de referencia 3]

Los compuestos listados en la decimocuarta table fueron sintetizados mediante un método similar al método del paso 2 del ejemplo de síntesis 7. En las Tablas, Me es un grupo metilo. Similarmente, Et es un grupo etilo, Pr es un grupo propilo, Pen es un grupo pentilo, Ph es un grupo fenilo, Bn es un grupo bencilo, n- es normal, i- es iso, c- es ciclo, y t- es terciario.

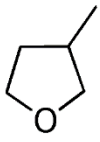
En las tablas, los sustituyentes de D-3a, D-4a, D-5, D-8a, D-9a, D-10a, D-11, D-12, D-13a, D-14, D-16a, D-16m y D-24f tienen las siguientes estructuras.



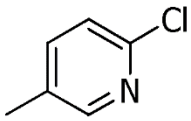
D-3a



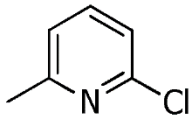
D-4a



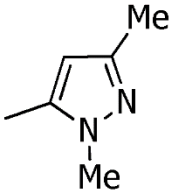
D-5



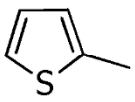
D-8a



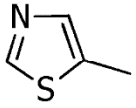
D-9a



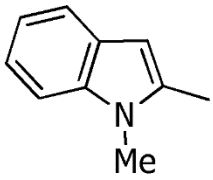
D-10a



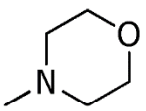
D-11



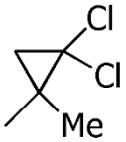
D-12



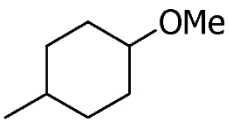
D-13a



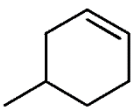
D-14



D-16a

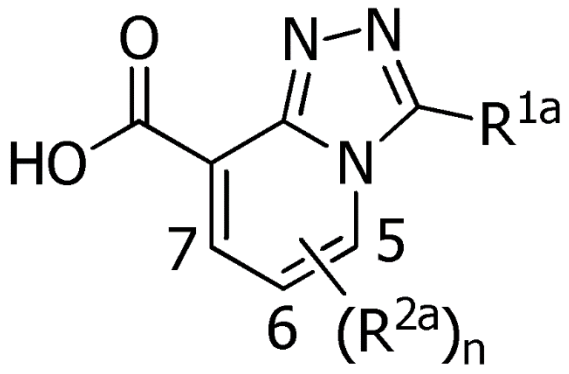


D-16m


D-24f

[0265] En las Tablas, "*1" es "Resinoso". Los datos de ^{1}H-NMR de los compuestos que no tiene puntos de fusión se encuentran en la Décimosexta Tabla.

[0266] [Decimocuarta Tabla]



[Tabla 45]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})n$	Punto de Fusión (°C)
C1-01	H	5-CF_3	*1
C1-02	c-Pr	5-CF_3	*1
C1-03	3-Pen	5-CF_3	137-139
C1-04	Ph	5-CF_3	*1
C1-05	CH_2OMe	5-CF_3	111－112
C1-06	4-MeO-Ph	5-CF_3	215-218
C1-07	4-Cl-Ph	5-CF_3	241-247
C1-08	$CH_2O(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	47-49
C1-09	$CH_2OCH_2CF_3$	5-CF_3	67-70
C1-10	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	5-CF_3	137-140
C1-11	D-3a	5-CF_3	197-201
C1-12	i-Pr	6-CF_3	224-226
C1-13	n-Pr	5-CF_3	134-135
C1-14	CH_2OPh	5-CF_3	136-140
C1-15	c-Pen	5-CF_3	156-158
C1-16	D-5	5-CF_3	195-200
C1-17	CH_2OEt	5-CF_3	96-97
C1-18	t-Bu	5-CF_3	125-131
C1-19	D-4a	5-CF_3	184-186
C1-20	CH_2SMe	5-CF_3	110-111
C1-21	$CH_2SCH_2CF_3$	5-CF_3	56-59
C1-22	$CH_2C(O)OEt$	5-CF_3	124-126
C1-23	4-Me-Ph	5-CF_3	250-253
C1-24	4-F-Ph	5-CF_3	249-251
C1-25	4-CF_3-Ph	5-CF_3	199-201
C1-26	3-MeO-Ph	5-CF_3	179-181
C1-27	2-MeO-Ph	5-CF_3	85-90
C1-28	i-Pr	5-CF_2H	193-195
C1-29	D-8a	5-CF_3	237-240
C1-30	D-9a	5-CF_3	231-234
C1-31	D-10a	5-CF_3	215-220
C1-32	D-11	5-CF_3	190-195
C1-33	D-12	5-CF_3	218-223
C1-34	D-13a	5-CF_3	185-188
C1-35	$CH_2OC(O)Me$	5-CF_3	126-128
C1-36	CH_2(4-MeO-Ph)	5-CF_3	73-75
C1-37	i-Pr	5-CF_2CF_3	170-175
C1-38	3,5-$(MeO)_2$-Ph	5-CF_3	158-160
C1-39	3,5-$(Cl)_2$-Ph	5-CF_3	250-252
C1-40	i-Pr	5-CF_3-6-Me	153-154
C1-41	i-Pr	5-CF_3-7-Me	190-192
C1-42	$(CH_2)_2SMe$	5-CF_3	149-151
C1-43	CH(Me)SMe	5-CF_3	145-146
C1-44	i-Pr	5-Ph	218-219
C1-45	i-Pr	5-{3,5-$(F)_2$-Ph}	210-220
C1-46	NMe_2	5-CF_3	181-183
C1-47	D-14	5-CF_3	210-213
C1-48	CH_2(c-Pr)	5-CF_3	109-114

[Tabla 46]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})n$	Punto de Fusión (°C)
C1-49	D-16a	5-CF_3	159-164
C1-50	C≡CMe	5-CF_3	234-238
C1-51	CH_2CF_3	5-CF_3	168-171
C1-52	CH_2CN	5-CF_3	227-231
C1-53	D-16m	5-CF_3	118-120
C1-54	D-24f	5-CF_3	169-170
C1-55	$(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	104-105

[Ejemplo de Referencia 4]

ácido 3- (etiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Paso 1; Síntesis del ácido 3-(tioxo)-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

A 20 ml de solución de metanol de 2.0 g de 3-tioxo-5- (trifluorometil) -2,3-dihidro-[1,2,4] triazolo [4,3-a] piridina-8-carboxilato de metilo sintetizado por un método similar al de la Etapa 1 del Ejemplo de Síntesis 8 que contiene imidazol, se añadió 17 ml de 0.5 mol/L de solución acuosa de hidróxido de sodio bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 3.5 horas. Después de terminar la reacción, se añadió 20 ml de 1 mol/L de ácido clorhídrico a la solución de reacción y el sólido precipitado en la solución de reacción se separó mediante filtración. El sólido obtenido se lavó con 1 mol/L de ácido clorhídrico, agua y eter diisopropilico en este orden y se filtró para proporcionar 1.1 g del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 235°C a 240°C

Paso 2; Síntesis del ácido 3-(etiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

A 10 ml de solución del ácido N,N-dimetilformamida de 700 mg (2.66 mmol) de 3-(tioxo)-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxílico, se añadió 898 mg (5.76 mmol) de yoduro de etilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 4 días. Después terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. Al residuo obtenido, se añadió 5 ml de agua y 5 ml de 1 mol/L de ácido clorhídrico y el sólido precipitado se separó mediante filtración. El sólido obtenido se lavó con agua y eter diisopropilico en este orden para proporcionar 486 mg del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 113°C a 114°C

[Ejemplo de Referencia 5]

Los siguientes compuestos fueron sintetizados por métodos similares a los Pasos 2 y 3 del Ejemplo de Síntesis 8 o Ejemplo de Referencia 4.

3- (isopropiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 120°C a 122°C

ácido 3- (isopropiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 135°C a 136°C

Ácido 3-((2-metoxietil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 106°C a 111°C

Ácido 3-(aliltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 96°C a 99°C

Ácido 3-(prop-2-in-1-iltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 179°C a 181°C

3- (n-propiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 87°C a 88°C

Ácido 3-(n-propiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 106°C a 108°C

3-(isobutiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 105°C a 106°C

Ácido 3-(isobutiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 110°C a 112°C

3-(s-butiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 88°C a 90°C

Ácido 3-(s-butiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 107°C a 109°C

3-(benciltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 130°C a 135°C

Ácido 3-(benciltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 153°C a 156°C

3-((4-metoxibencil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 119°C a 121°C

Ácido 3-((4-metoxibencil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 180°C a 182°C

3-((ciclopropilmetil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 122°C a 123°C

Ácido 3-((ciclopropilmetil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 127°C a 129°C

3-(((tetrahidrofuran-2-il)metil))tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

^{1}H NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 7.95 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.42 (d, 1H, J=7.2Hz), 4.34-4.25 (m, 1H), 4.09 (s, 3H), 3.92-3.84 (m, 1H), 3.79-3.68 (m, 2H), 3.56-3.49 (m, 1H), 2.17-2.06 (m, 1H), 1.99-1.87 (m, 2H), 1.76-1.68 (m, 1H).

Ácido 3-(((tetrahidrofuran-2-il)metil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 108°C a 112°C

3-((cianometil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 146°C a 148°C

Ácido 3-((cianometil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 138°C a 140°C

3-((2-oxopropil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 84°C a 87°C

Ácido 3-((2-oxopropil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 121°C a 124°C

3-((1,3-dioxan-2-il)metil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 99°C a 102°C

Ácido 3-((1,3-dioxolan-2-il)metil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 110°C a 112°C

Ácido 3-((2,2,2-trifluorometil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 150°C a 151°C

Ácido 3-((2-metoxi-2-oxoetil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 143°C a 144°C

3-(ciclopentiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 92°C a 94°C

Ácido 3-(ciclopentiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 143°C a 146°C

3-(((6-cloropiridin-3-il)metil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 99°C a 100°C

3-(((6-cloropiridin-3-il)metil)tio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato

Punto de fusión: 159°C a 160°C

[Ejemplo de Referencia 6]

Síntesis de 2-metil-3-oxo-5- (trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

A la mezcla de 500 mg (1.91 mmol) de 3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo, 525 mg (3.82 mmol) de carbonato de potasio y 10 ml de acetonitrilo, se añadió 298 mg (2.10 mmol) de yoduro de metilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 5 horas. Después de terminar la reacción, se añadió 20 ml de cloroformo a la solución de reacción y el sólido precipitado se separó mediante filtración. El solvente en la solución obtenida mediante la filtración se separó por destilación bajo presión reducida. El residuo obtenido después de destilar el solvente se purificó con cromatografía líquida preparativa de presión media eluyendo el residuo con acetato de n-hexano-etilo (gradiente de 17:1 a 2:3) para proporcionar 312 mg del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 189°C a 190°C

Los siguientes compuestos fueron sintetizados por un método similar.

2-etil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 135°C a 137°C

2-isopropil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 124°C a 125°C

2-bencil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

Punto de fusión: 99°C a 100°C

[Ejemplo de Referencia 7]

Síntesis del ácido 2-metil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

A 3 ml de solución de etanol de 312 mg (1.13 mmol) de 2-metil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo, se añadió 3 ml de solución acuosa de 50 mg (1.25 mmol) de hidróxido de sodio bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a la misma temperatura. Después de terminar la reacción, se añadió 3 ml de mol/L de ácido clorhídrico a la solución de reacción y la mezcla resultante se extrajo con diclorometano (10 ml, 3 vez). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 250 mg del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 155°C a 160°C

Los siguientes compuestos fueron sintetizados por un método similar.

Ácido 2-etil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 160°C a 163°C

Ácido 2-isopropil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 160°C a 162°C

Ácido 2-bencil-3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Punto de fusión: 84°C a 86°C

[Ejemplo de Referencia 8]

Síntesis de 3-tioxo-5- (trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

100 mg de la mezcla de 3-tioxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo sintetizado por el método de la Etapa 1 del Ejemplo de Síntesis 8 e imidazol se disolvió en 50 ml de acetato de etilo y la mezcla resultante se lavó con 20 ml 1 mol/Lde ácido clorhídrico. La fase orgánica obtenida se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida para propocionar 63 mg del producto diana como un sólido de color naranja-amarillo.

Punto de fusión: 218°C a 220°C

[Ejemplo de Referencia 9]

Ácido 3-(fenilamino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Paso 1;Síntesis de 2- (2- (fenilcarbamoil) hidrazinilo)-6-(trifluorometil)nicotinato de metilo

A 13 ml de solución de tetrahidrofurano de 500 mg (2.13 mmol) de 2-hidrazinil-6-(trifluorometil) nicotinato de metilo, se añadió 255 mg (2.14 mmol) de isocianato de fenilo bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 14 hora a la misma temperatura. Después terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico para proporcionar 740 mg del producto diana como un sólido blanco.

Punto de fusión: 190°C a 195°C

Paso 2; Síntesis de 3-(fenilamino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

A la solución mixta de 730 mg (2.06 mmol) de 2-(2-(fenilcarbomoil)hidrazinil)-6-(trifluorometil)nicotinato de metilo y 15 ml de tolueno, se añadió 940 mg (6.11 mmol) de cloruro de fosforilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 3 horas con calentamiento a reflujo. Después de terminar la agitación, la mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se añadió a agua helada para terminar la reacción. A partir de entonces, el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (30 ml, 2 vez). La fase orgánica obtenida se secó sobre sulfato de sodio y el solvente se separo por destilación bajo presión reducida. El residuo obtenido se purificó con cromatografía líquida preparativa de presión media

eluyendo el residuo n-hexano-eti-acetato-metanol (gradiente de 10:1 a 0:10) para proporcionar 480 mg del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 225°C a 230°C

Paso 3; Síntesis del ácido 3-(fenilamino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

A la solución mixta de 470 mg (1.40 mmol) de 3-(fenilamino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo y 10 ml de metanol, se añadió 8.0 ml (8.0 mmol) de 1 mol/L de solución acuosa de hidróxido de sodio bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la solución de reacción se agitó durante 3 horas bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida y a partir de entonces se añadió ácido clorhídrico 1 N a la solución de reacción para ajustar el pH entre 5 y 6. El líquido mezclado de reacción se extrajo con acetato de etilo (30 ml, 2 veces) y la fase orgánica obtenida se secó sobre sulfato de sodio anhidro, seguido por separación por destilación del solvente bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico para proporcionar 250 mg del producto diana como un sólido de color naranja.

Punto de fusión: 125°C a 130°C

[Ejemplo de Referencia 10]

Ácido 3-((2-metoxietil(metil)amino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

Paso 1; Síntesis de 2-(2-((2-metoxietil)(metil)carbamoil)hidrazinilo) 6-(trifluorometil)nicotinato de etilo

Una mezcla de 500 mg (1.82 mmol) de 3-oxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de etilo, 320 mg (3.59 mmol) de N-(2-metoxietil)metilamina, y 10 ml de tetrahidrofurano se agitó durante 3 horas con calentamiento a reflujo. Después terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. El residuo obtenido se purificó con cromatografía líquida preparativa de presión media eluyendo el residuo con acetato de n-hexano-etilo (gradiente de 90:10 a 0:100) para proporcionar 610 mg del producto diana como un sólido amarillo claro.

Punto de fusión: 65°C a 66°C

Paso 2; Síntesis de 3-((2-metoxietil)(metil)amino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de etilo

A la solución mixta de 595 mg (1.63 mmol) de 2-(2-(2-metoxietil)(metil)carbamoil)hidrazinil)-6-(trifluorometil)nicotinato de etilo y 10 ml de tolueno, se añadió 750 mg (4.94 mmol) de cloruro de fosforilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 1,5 horas con calentamiento a reflujo. Después de terminar la agitación, la mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se añadió a agua helada para terminar la reacción. Posteriormente se añadió solución acuosa de hidrógeno carbonato de sodio para ajustar el pH entre 8 y 9. A partir de entonces, la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (30 ml, 2 veces). La fase orgánica obtenida se secó sobre sulfato de sodio y el solvente se separo por destilación bajo presión reducida. El residuo obtenido se purificó con cromatografía líquida preparativa de presión media eluyendo el residuo con acetato de n-hexano-etilo (gradiente de 90:1 a 10:100) para proporcionar 520 mg del producto diana como un sólido amarillo.

^{1}H NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 7.91 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.80 (d, 1H, J=7.2Hz), 4.55 (q, 2H, J=6.9Hz), 3.75-3.41 (m, 4H), 3.27 (s, 3H), 2.87 (s, 3H), 1.48 (t, 3H, J=6.9Hz).

Paso 3; Síntesis del ácido 3-((2-metoxietil)(metil)amino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

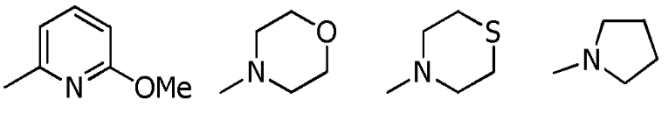
A la solución mixta de 500 mg (1.44 mmol) de 3-((2-metoxoetil)(metil)amino)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílato de etilo y 10 ml de etanol, se añadió 4.5 ml (4.5 mmol) de 1 mol/L de solución acuosa de hidróxido de sodio bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 1hora bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida y a partir de entonces se añadió ácido clorhídrico a la solución de reacción para ajustar el pH a 4. El líquido mezclado de reacción se extrajo con acetato de etilo (30 ml, 2 veces) y la fase orgánica obtenida se secó sobre sulfato de sodio anhidro, seguido por separación por destilación del solvente bajo presión reducida para proporcionar 470 mg del producto diana como un sólido amarillo claro.

Punto de fusión: 115°C a 120°C

[Ejemplo de Referencia 11]

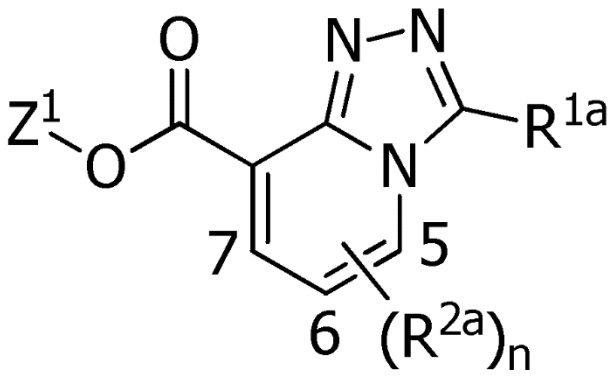
Los compuestos listados en la Tabla quince fueron sintetizados por un método similar al Ejemplo de Referencia 9 o el Ejemplo de Referencia 10. En las Tablas, Me es un grupo metilo. Del mismo modo, Et es grupo etilo, Ph es un grupo fenilo, y c- es ciclo.

En las tablas, los sustituyentes de D-9b, D-14, D-17, y D-19 tienen las siguientes estructuras.



D-9b D-14 D-17 D-19

[0282] [Quinceava Tabla]



[Tabla 47]

No.	R^{1a}	$(R^{2a})n$	Z'	Punto de Fusión (°C)
C2-01	N(Me)Ph	5-CF_3	H	160-170
C2-02	$NHCH(CH_3)_2$	5-CF_3	H	145-146
C2-03	D-14	5-CF_3	H	210-213
C2-04	NH(D-9b)	5-CF_3	H	170-174
C2-05	$NH(CH_2)_2OMe$	5-CF_3	H	150-155
C2-06	$NHSO_2Ph$	5-CF_3	H	>290
C2-07	D-17	5-CF_3	H	160-165
C2-08	$NH(CH_2)_2SMe$	5-CF_3	H	173-176
C2-09	$NHCH_2CF_3$	5-CF_3	H	180-183
C2-10	$N(Me)CH(CH_3)_2$	5-CF_3	H	135-137
C2-11	N(Me)Hex-c	5-CF_3	H	184-186
C2-12	N(Me)Et	5-CF_3	H	140-141
C2-13	$N(Et)_2$	5-CF_3	H	126-127
C2-14	D-19	5-CF_3	H	150-151
C2-15	$N(Me)CH_2C\equiv CH$	5-CF_3	H	133-134
C2-16	$N(Me)(CH_2)_2CN$	5-CF_3	H	136-137
C2-17	N(Me)(4-MeO-Ph)	5-CF_3	H	168-171
C2-18	$N(Me)CH_2CH=CH_2$	5-CF_3	H	117-118
C2-19	$N(Me)CH_2$(4-MeO-Ph)	5-CF_3	H	105-110

[0283] [Decimosexta Tabla]

[Tabla 48]

No.	^{1}H-NMR ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz)
A1-01a	δ 10.02 (brs, 1H), 8.34 (d, 1H, J=7.8Hz), 8.26 (s, 1H), 8.23 (brs, 1H), 7.11 (d, 1H, J=7.8Hz), 3.96 (s, 3H)。
A1-04a	δ 10.21 (d, 1H, J=6.0Hz), 8.84 (d, 1H, J=5.7Hz), 8.35 (dd, 1H, J=7.2Hz, 0.9Hz), 7.88-7.85 (m, 2H), 7.56-7.46 (m, 3H), 7.08 (d, 1H, J=7.8Hz), 3.98 (s, 3H)。
A1-08a	δ 9.70 (brs, 1H), 9.26 (brs, 1H), 8.32 (d, 1H, J=7.8Hz), 7.07 (d, 1H, J=7.8Hz), 4.21 (s, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.89-3.86 (m, 2H), 3.65-3.62 (m, 2H), 3.40 (s, 3H)。
B1-01a	δ 9.04 (d, 1H, J=1.8Hz), 8.14 (d, 1H, J=6.6Hz), 7.41 (d, 1H, J=6.6Hz), 4.13 (s, 3H)。
B1-02a	δ 7.95 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.44 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.09 (s, 3H), 2.32-2.25 (m, 1H), 1.38-1.33 (m, 2H), 1.22-1.16 (m, 2H)。
B1-04a	δ 8.04 (dd, 1H, J=7.2Hz, 0.6Hz), 7.60-7.42 (m, 6H), 4.14 (s, 3H)。
B1-08a	δ 8.04 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.49 (d, 1H, J=7.2Hz), 5.21 (d, 2H, J=0.9Hz), 4.11 (s, 3H), 3.75-3.72 (m, 2H), 3.54-3.51 (m, 2H), 3.33 (s, 3H)。
B1-27a	δ 8.04 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.45-7.60 (m, 1H), 7.35-7.45 (m, 2H), 7.00-7.15 (m, 1H), 6.90-7.00 (m, 1H), 4.13 (s, 3H), 3.65 (s, 3H)。
B1-29a	δ 8.49 (s, 1H), 8.00-8.15 (m, 1H), 7.75-7.85 (m, 1H), 7.40-7.60 (m, 2H), 4.13 (s, 3H)。
B1-34a	δ 8.17 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.70 (d, 1H, J=8.1Hz), 7.54 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.35-7.45 (m, 2H), 7.20-7.30 (m, 2H), 4.17 (s, 3H), 3.54 (s, 3H)。
B1-49a	δ 8.00 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.54 (d, 1H, J=7.5Hz), 4.10 (s, 3H), 2.91 (d, 1H, J=7.5Hz), 1.91 (d, 1H, J=7.5Hz), 1.85 (s, 3H)。
C1-01	δ 9.06 (d, 1H, J=1.5Hz), 8.33 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.57 (d, 1H, J=6.9Hz)。(No se observa el pico del proton CO_2H)
C1-02	δ 8.38 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.60 (d, 1H, H=7.5Hz), 2.39-2.28 (m, 1H), 1.42-1.35 (m, 2H), 1.29-1.23 (m, 2H)。(No se observa el pico del proton CO_2H)
C1-04	δ 8.30 (d, 1H, J=6.9Hz), 7.60-7.49 (m, 6H)。(No se observa el pico del proton CO_2H)

[0284] Ejemplos de Prueba

Subsecuentemente, la utilidad del compuesto de la presente invención como herbicida será descrita d emanera específica en los siguientes efemplos de Prueba. La presente invención, no obstante, se limita a estos Ejemplos de Prueba.

[Ejemplo de Prueba 1] Prueba de actividad herbicida mediante la aplicación antes de la generación de maleza en condiciones de sumersión.

Después que el suelo aluvial se colocó en 1/10000 en un contenedor Wagner, el agua se vierte y se mezcla para formar una condición sumergida que tiene una profundidad de 4 cm. Malezas def *Echinochloa oryzacola Vasing.*, *Scirpus juncoides*, y *Monochoria vaginali*s se sembraron en una forma mixta en la parte superior del contenedor y a partir de entonces las hojas de la etapa de 2,5

Oryza sativa fueron trasplantadas. En el día de la siembra de semillas, el agente de emulsión que contiene el compuesto de la presente invención preparado de acuerdo con el Ejemplo de Formulación 2 se diluyó con agua de manera que sea una cantidad predeterminada del herbicida y el compuesto diluido se aplicó a la superficie del agua. El contendor se colocó en un invernadero de 25°C a 30°C para que la planta creciera. Tres semanas después de la aplicación de los herbicidas, los efectos sobre cada planta se investigaron de acuerdo con los siguientes criterios. Los resultados se enumeran en la decimoséptima Tabla.

Criterio

5 Porporción herbicida de 90% o más (casi amrchito por completo)

4 Porporción herbicida de 70% o más y menos de 90%

3 Porporción herbicida de 40% o más y menos de 70%

2 Porporción herbicida de 20% o más y menos de 40%

1 Porporción herbicida de 5% o más y menos de 20%

0 Porporción herbicida de 5% o menos (casi no se ve el efecto)

[0285] [Ejemplo de Prueba 1] Prueba de actividad herbicida mediante la aplicación durante de la generación de maleza en condiciones de sumersión.

Después que el suelo aluvial se colocó en 1/10000 en un contenedor Wagner, el agua se vierte y se mezcla para formar una condición sumergida que tiene una profundidad de 4 cm. Malezas def *Echinochloa oryzacola Vasing.*, *Scirpus juncoides*, y *Monochoria vaginali*s se sembraron en una forma mixta en la parte superior del contenedor y a partir de entonces las hojas de la etapa de 2,5 *Oryza sativa* fueron trasplantadas. En el día de la siembra de semillas, el agente de emulsión que contiene el compuesto de la presente invención preparado de acuerdo con el Ejemplo de Formulación 2 se diluyó con agua de manera que sea una cantidad predeterminada del herbicida y el compuesto diluido se aplicó a la superficie del agua. Tres semanas después de la aplicación de herbicidas, los efectos sobre cada planta se investigaron de acuerdo con los criterios del Ejemplo de Ensayo 1. Los resultados se enumeran en la DecimoctavaTabla.

[0286] [Ejemplo de Prueba 3] Prueba de efecto herbicida mediante la aplicación al follaje.

Después que el suelo aluvial se colocó en 1/10000 en un contenedor Wagner, el agua se vierte y se mezcla para formar una condición sumergida que tiene una profundidad de 4 cm. Malezas def *Echinochloa oryzacola Vasing.*, *Scirpus juncoides*, y *Monochoria vaginali*s se sembraron en una forma mixta en la parte superior del contenedor y a partir de entonces las hojas de la etapa de 2,5

Oryza sativa fueron trasplantadas. En el día de la siembra de semillas, el agente de emulsión que contiene el compuesto de la presente invención preparado de acuerdo con el Ejemplo de Formulación 2 se diluyó con agua de manera que sea una cantidad predeterminada del herbicida y el compuesto diluido se aplicó a una parte del tallo y las hojas con un spray de pequeño tamaño. Tres semanas después de la aplicación de herbicidas, los efectos sobre cada planta se investigaron de acuerdo con los criterios del Ejemplo de Ensayo 1. Los resultados se enumeran en la DecimonovenaTabla.

[0287] [Ejemplo de prueba 4] Prueba de efecto herbicida mediante la aplicación al follaje.

El suelo diluvial esterilizado se coloca en una caja de plástico que tiene una longitud de 21 cm, una anchura de 13 cm, y una profundidad de 7 cm. Cada una de las semillas de *Digitaria ciliaris*, *Setaria viridis*, *Echinochloa crus-galli var. crus-galli*, *Avena fatua*, *Alopecurus myosuroides*, *Lolium multiflorum Lam.*, *Apera spica-venti.*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus*, *Chenopodium album*, *Stellaria media*, *Galium spurium*, *Veronica persica*, *Zea mays*, *Glycine max*, *Oryza sativa*, *Triticum aestivum*, *Beta vulgaris ssp. vulgaris*, and *Brassica campestris L.* se sembraron en una manera in situ y como estaba cubierta con el suelo de aproximadamente 1,5 cm de espesor. A continuación, las plantas se cultivaron en el invernadero de 25°C a 30°C. Después de que las plantas se cultivaron durante 14 días, el agente de emulsión que contiene el compuesto de la presente invención preparado de acuerdo con el Ejemplo de Formulación 2 se diluyó con agua de manera que sea una cantidad predeterminada de herbicida y el compuesto diluido se aplica uniformemente a parte del tallo y las hojas con un spray de pequeño tamaño. Tres semanas después de la aplicación de herbicidas, los efectos sobre cada planta se investigaron de acuerdo con los criterios del Ejemplo de Ensayo 1. Los resultados se enumeran en la Vigésima Tabla XX.

[0288] Los símbolos d ela stablas 17 a 20 tienen los siguientes significados:.
A: *Echinochloa oryzicola Vasing.*, B: *Scirpus juncoides*, C: *Monochoria vaginalis*, D: *Leptochloa chinensis*, E: *Cyperus difformis*, F: *Digitaria ciliaris*, G: *Setaria viridis*, H: *Echinochloa crus-galli var. crus-galli*, I: *Avena fatua*, J: *Alopecurus myosuroides*, K: *Lolium multiflorum Lam.*, L: *Apera spica-venti.*, M: *Abutilon theophrasti*, N: *Amaranthus retroflexus*, O: *Chenopodium album*, P: *Stellaria media*, Q: *Galium spurium*, R: *Veronica persica*, a: transplanted *Oryza sativa*, b: directly sowed *Oryza sativa*, c: *Zea mays*, d: *Glycine max*, e: *Triticum aestivum*, f: *Beta vulgaris*

ssp. vulgaris, and g: *Brassica campestris L.*

The application herbicide amount (g/ha) means an amount that a concentration is adjusted so that, when an application amount is converted into per hectare (1 ha), the herbicide is applied by the number of grams (g) of the described value.

[0289] [Decimoséptima Tabla]

[Tabla 49]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C	a
1-001	320	3	2	2	0
1-002	320	2	1	0	0
1-004	320	5	4	4	1
1-005	320	5	4	4	0
1-010	320	5	3		0
1-011	320	5	4	5	1
1-012	320	5	3	4	0
1-014	320	5	4	3	0
1-015	320	2	3	3	0
1-016	320	4	0	0	0
1-017	320	3	2	0	0
1-018	320	1	3	5	0
1-019	320	5	3	4	2
1-020	320	4	3	2	0
1-021	320	5	4	4	2
1-022	320	2	2	0	0
1-024	320	5	2	0	0
1-026	320	5	4	4	2
1-027	320	5	3	4	1
1-029	320	5	3	4	2
1-030	320	5	3	3	0
1-031	320	4	3	3	0
1-032	320	5	3	2	2
1-033	320	5	4	3	0
1-034	320	4	4	4	3
1-035	320	5	4	4	2
1-036	320	4	3	3	4
1-037	320	0	2	3	0
1-038	320	2	2	1	0
1-040	320	3	3	3	1
1-041	320	3	3	3	0
1-042	320	2	2	2	0
1-043	320	5	3	3	3
1-044	320	5	3	3	1
1-046	320	5	3	3	2
1-047	320	4	3	2	1
1-048	320	3	0	0	1
1-049	320	5	2	0	0
1-050	320	5	5	4	2
1-051	320	5	4	4	0
1-052	320	3	3	2	0
1-053	320	2	3	2	0
1-054	320	5	3	4	2
1-055	320	4	4	4	1
1-056	320	5	5	4	3
1-057	320	5	5	4	2
1-058	320	5	5	4	4

[Tabla 50]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C	a
1-059	320	2	3	2	0
1-060	320	4	4	3	2
1-062	320	3	2	1	0
1-063	320	5	4	3	0
1-064	320	5	4	3	0
1-065	320	5	3	2	0
1-066	320	5	4	2	2
1-067	320	3	0	0	0
1-068	320	2	3	3	0
1-069	320	5	4	3	0
1-070	320	5	5	5	3
1-071	320	4	5	4	0
1-073	320	4	3	2	3
1-074	320	2	2	0	0
1-075	320	2	0	2	0
1-076	320	5	4	4	3
1-077	320	0	0	2	0
1-078	320	4	4	3	4
1-079	320	4	4	3	4
1-080	320	5	4	4	4
1-082	320	3	2	2	0
1-083	320	2	3	3	0
1-084	320	2	3	2	0
1-085	320	3	4	3	3
1-086	320	5	4	4	5
1-087	320	5		3	0
1-090	320	3	4	2	0
1-091	320	5	5	5	0
1-092	320	5	5	4	3
1-093	320	5	4	3	0
1-094	320	5	5	3	0
1-095	320	5	5	5	1
1-096	320	5	4	4	3
1-100	320	4	3	3	0
1-102	320	3	2	2	2
1-103	320	5	4	4	3
1-104	320	4	3	2	0
1-105	320	5	5	4	0
1-106	320	5	5	4	1
1-107	320	5	4	5	2
1-108	320	5	5	5	0
1-109	320	0	2	0	0
1-110	320	5	4	4	4
1-112	320	3	3	2	0
1-113	320	4	3	2	0
1-114	320	3	2	0	0
1-115	320	5	4	3	0

[Tabla 51]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C	a
1-116	320	5	4	2	0
1-118	320	3	2	0	2
1-119	320	2	1	0	3
1-120	320	5	3	1	3
1-121	320	5	4	4	3
1-122	320	5	5	5	3
1-123	320	5	4	4	1
1-124	320	3	3	1	0
1-125	320	0	3	1	0
1-126	320	3	4	2	0
1-128	288	5	4	2	0
1-129	320	5	4	3	1
1-130	320	1	0	0	1
1-131	320	2	1	0	0
1-132	320	5	4	4	2
1-133	320	5	3	4	0
1-134	320	3	3	2	0
1-135	320	3	4	4	1
1-136	320	5	3	3	1
1-137	320	5	5	5	3
1-138	320	5	5	4	2
1-139	320	5	4	3	2
1-143	320	0	0	2	0
1-144	320	5	3	3	1
1-145	320	5	5	5	4
1-146	320	5	5	5	3
1-147	320	5	5	5	2
1-148	320	5	5	5	4
1-149	320	5	4	3	3
1-150	320	5	5	5	4
1-151	320	5	5	3	0
1-152	320	5	4	3	2
1-153	320	3	3	4	2
1-154	320		3	2	0
1-155	320		4	3	0
1-156	320		2	0	0
1-157	320		3	2	2
1-158	320		4	0	0
1-159	320		3	0	0
1-161	320		2	0	0
1-162	320		2	0	0
1-163	320		4	4	2
1-164	320		5	4	3
1-165	320	4	3	4	0
1-166	320		3	2	0
1-167	320	4	2	0	0
1-169	320	5	4	4	0

[Tabla 52]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C	a
1-171	320	5	4	4	1
1-172	320	5	4	3	1
2-001	320	2	3	4	0
2-002	320	2	3	3	0
2-003	320	5	5	5	4
2-005	320	5	5	5	0
2-006	320	5	5	5	4
2-007	320	5	5	5	3
2-008	320	4	4	4	1
2-009	320	3	3	4	0
2-010	320	5	5	4	4
2-011	320	5	5	5	2
2-012	320	5	4	3	1
2-013	320	5	4	5	3
2-014	320	5	5	5	4
2-015	320	5	5	5	1
2-016	320	5	5	5	4
2-017	320	5	3	4	4
2-019	320	5	5	4	2
2-020	320	3	2	2	1
2-021	320	5	5	5	4
2-022	320	5	5	5	5
2-023	320	2	1	0	3
2-024	320	5	5	5	5
2-025	320	5	5	5	5
2-026	320	5	5	4	4
2-027	320	5	5	5	4
2-028	320	5	5	5	5
2-029	320	5	5	5	5
2-030	320	5	4	4	3
2-031	320	5	5	5	5
2-032	320	5	5	5	5
2-033	320	5	4	5	4
2-034	320	5	4	4	4
2-035	320	4	3	3	4
2-037	320	5	5	5	4
2-038	320	5	5	5	4
2-039	320	5	5	5	4
2-040	320	4	4	4	4
2-041	320	5	5	4	0
2-042	320	5	4	4	5
2-043	320	5	5	5	4
2-044	320	5	5	5	4
2-045	320	5	5	5	5
2-046	320	4	0	0	0
2-047	320	5	4	5	4
2-048	320	5	5	4	4

[Tabla 53]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C	a
2-049	320	5	5	4	3
2-050	192	4	2	3	2
2-051	320	5	5	5	4
2-052	320	5	5	5	5
2-053	320	5	5	4	5
2-054	320	5	5	5	5
2-056	320	4	4	3	1
2-057	320	4	4	4	4
2-058	320	4	4	5	5
2-059	320	4	4	4	5
2-060	320	5	5	5	5
2-061	320	5	5	5	4
2-062	320	5	5	5	5
2-063	320	5		5	4
2-064	320	5		2	3
2-065	320	5	4	4	2
2-066	320	5	5	4	3
2-067	320	5	4	4	5
2-068	320	5	5	4	5
2-069	320	5	5	5	5
2-070	320	5	5	5	4
2-071	320	5	5	5	4
2-072	320	5	5	5	3
2-073	320	4	3	4	2
2-074	320	4	4	3	3
2-075	320	5	5	5	5
2-076	320	5	4	3	2
2-077	320	5	3	3	1
2-078	320	5	4	2	4
2-079	320	5	5	5	4
2-080	320	3	0	0	2
2-081	320	4	3	4	3
2-082	320	5	5	5	5
2-083	320	5	5	4	2
2-084	320	5	5	4	4
2-085	320	5	5	4	1
2-086	320	3	2	3	0
2-087	320	5	5	4	3
2-088	141	5	5	5	3
2-089	320	5	5	5	4
2-090	320	5	5	5	4
2-091	320	5	5	5	0
2-093	320	5	5	4	2
2-094	320	5	5	5	4
2-095	320	5	5	5	5
2-096	320		5	4	3
2-097	320		4	3	1

[Tabla 54]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C	a
2-098	320		5	4	2
2-099	320	5	4	5	4
2-100	320	5	5	5	3
2-101	320	5	5	5	3
2-102	320	5	5	4	1
2-103	320	5	4	5	3
2-105	320	5	5	5	4
2-106	320	5	3	4	2
2-107	320	2	3	2	1
2-108	320	4	3	2	0
2-109	260	2	3		0
2-110	320	5	5	5	4
4-003	320		2	0	0
6-002	320	4	3	2	0
6-004	320	0	0	2	0
7-001	320	0	2	4	0
7-002	320	3	3	4	1

[0290] [Decimoctava Tabla]

[Tabla 55]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C
1-001	320	4	4	2
1-002	320	3	0	0
1-004	320	4	3	4
1-005	320	5	1	0
1-010	320	4	1	4
1-011	320	5	3	3
1-012	320	2	2	2
1-014	280	2	3	0
1-015	320	4	2	1
1-016	320	3	0	0
1-017	320	2	2	0
1-018	320	0	2	0
1-019	320	4	3	3
1-020	320	2	2	2
1-021	320	4	4	3
1-022	320	2	2	0
1-024	320	4	1	0
1-026	320	3	1	0
1-027	320	4	3	3
1-029	320	3	2	3
1-030	320	4	3	3
1-031	320	3	2	2
1-032	320	4	3	3
1-033	320	4	4	3
1-034	320	4	3	4
1-035	320	5	4	4
1-036	320	3	2	4
1-037	320	2	2	
1-038	320	1	1	0
1-040	320	3	2	
1-041	320	2	3	
1-042	320	1	2	3
1-043	320	3	3	3
1-044	320	2	3	2
1-046	320	4		
1-047	320	3	2	3
1-048	320	0	1	0
1-049	320	4	2	2
1-050	320	5	4	3
1-051	320	4	3	4
1-052	320	1	1	0
1-053	320	1	2	0
1-054	320	4	3	3
1-055	320	3	3	3
1-056	320	5	4	4
1-057	320	2	3	3
1-058	320	4	5	4

[Tabla 56]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C
1-059	320	2	3	2
1-060	320	2	3	2
1-061	320	0	1	1
1-062	320	2	2	2
1-063	320	4	3	2
1-064	320	2	3	2
1-065	320	1	2	2
1-066	320	2	3	2
1-068	320	2	2	2
1-069	320	4	4	4
1-070	320	5	5	5
1-071	320	3	5	4
1-073	320	2	2	1
1-074	320	2	0	0
1-076	320	2	0	4
1-078	320	4	3	3
1-079	320	4	3	4
1-080	320	5	3	4
1-083	320	2	2	2
1-084	320	2	1	0
1-085	320	3	2	2
1-086	320	4	4	4
1-087	320	4		3
1-090	320	2	1	3
1-091	320	5	5	5
1-092	320	4	4	3
1-093	320	3	3	3
1-094	320	4	3	3
1-095	320	4	5	4
1-096	320	4	3	4
1-100	320	4	3	4
1-102	320	1	1	1
1-103	320	4	5	4
1-104	320	4	3	3
1-105	320	3	4	3
1-106	320	5	5	4
1-107	320	5	4	4
1-108	320	4	4	3
1-109	320	0	1	0
1-110	320	4	3	4
1-112	320	1	2	0
1-113	320	2	0	0
1-114	320	0	1	0
1-115	320	3	3	
1-116	320	3	4	0
1-118	320	2	3	0
1-119	320	4	1	0

[Tabla 57]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C
1-120	320	3	3	2
1-121	320	4	4	4
1-122	320	4	3	3
1-123	320	3	2	3
1-124	320	3	3	1
1-125	320	0	2	1
1-126	320	1	3	3
1-128	288	1	3	0
1-129	320	3	4	3
1-131	320	0	1	0
1-132	320	4	4	4
1-133	320	2	2	3
1-134	320	1	3	3
1-135	320	2	2	3
1-136	320	0	2	2
1-137	320	3	3	3
1-138	320	3	3	3
1-139	320	4	3	3
1-144	320	4	4	3
1-145	320	4	4	4
1-146	320	3	3	3
1-147	320	4	2	3
1-148	320	5	5	4
1-149	320	3	3	2
1-150	320	5	5	4
1-151	320	4	4	2
1-152	320	3	3	3
1-153	320	3	3	3
1-154	320	0	2	0
1-155	320	1	2	0
1-156	320	0	3	2
1-157	320	0	1	0
1-158	320	2	3	0
1-159	320	3		
1-162	320	3	1	0
1-163	320	4		
1-164	320	4	4	4
1-165	320	2	2	
1-166	320	2	3	
1-168	320	2	2	
1-169	320	3	4	4
1-171	320	4		
1-172	320	3	4	3
1-173	320	3	2	2
2-001	320	2	2	3
2-002	320	2	1	2
2-003	320	5	3	4

[Tabla 58]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C
2-005	320	5	3	4
2-006	320	5	5	5
2-007	320	4	4	4
2-008	320	3	2	3
2-009	320	3	2	3
2-010	320	5	4	4
2-011	320	4	3	4
2-012	320	4	5	5
2-013	320	5	3	2
2-014	320	5	5	5
2-015	320	4	5	4
2-016	320	5	5	5
2-017	320	5	4	4
2-019	320	4	3	4
2-020	320	2	2	0
2-021	320	5	4	4
2-022	320	5	5	4
2-023	320	0	1	1
2-024	320	5	4	4
2-025	320	5	4	5
2-026	320	5	5	4
2-027	320	5	4	4
2-028	320	5	4	4
2-029	320	5	4	4
2-030	320	4	3	4
2-031	320	5	4	4
2-032	320	5	5	5
2-033	320	4	3	4
2-034	320	5	4	4
2-035	320	2	2	3
2-037	320	5	5	5
2-038	320	5	4	5
2-039	320	5	5	5
2-040	320	4	3	4
2-041	320	5	4	3
2-042	320	4	3	4
2-043	320	5	4	4
2-044	320	5	4	4
2-045	320	5	3	4
2-047	320	3	5	4
2-048	320	3	4	3
2-049	320	5	5	4
2-050	192	1	0	2
2-051	320	5	5	5
2-052	320	5	4	4
2-053	320	5	4	4
2-054	320	5	4	5

[Tabla 59]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C
2-056	320	3	3	3
2-057	320	4	4	4
2-058	320	4	4	4
2-059	320	4	3	4
2-060	320	5	3	5
2-061	320	4	5	5
2-062	320	5	4	5
2-060	320	5	4	5
2-061	320	4	5	5
2-062	320	5	4	5
2-063	320	5	4	5
2-064	320	3	4	3
2-065	320	5	4	4
2-066	320	3		3
2-067	320	5	4	5
2-068	320	5	5	4
2-069	320	5	5	5
2-070	320	5	5	5
2-071	320	3	5	5
2-072	320	5	5	5
2-073	320	2	2	3
2-074	320	4	4	3
2-075	320	5	5	5
2-076	320	2	3	2
2-077	320	2	2	2
2-078	320	4	4	3
2-079	320	5	5	5
2-080	320	2	1	0
2-081	320	2	2	2
2-082	320	5	4	3
2-083	320	3	3	3
2-084	320	4	4	3
2-085	320	4	4	3
2-086	320	0	2	1
2-087	320	4	4	3
2-088	141	4	3	4
2-089	320	4	4	5
2-090	320	5	5	4
2-091	320	4	5	4
2-093	320	2	4	3
2-094	320	5	5	4
2-095	320	4	5	5
2-096	320	3	3	3
2-097	320	0	2	2
2-098	320	5	4	3
2-099	320	5	5	4
2-100	320	4	3	4

[Tabla 60]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	A	B	C
2-101	320	4	4	5
2-102	320	4	4	4
2-103	320	4	3	4
2-105	320	4	4	4
2-106	320	1	2	3
2-107	320	2	1	2
2-108	320	0	1	
2-109	260	1	1	
2-110	320	5	5	4
6-002	320	3	2	3
6-004	320	3	0	2
7-002	320	4	2	2

[0291] [Decimonovena Tabla]

[Tabla 61]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	H	D	E	b
1-001	320	5	5	4	0
1-002	400	4	4		0
1-004	400	4	5	5	0
1-005	400	2	5	5	0
1-008	320	3	0		0
1-010	400	5	5	4	0
1-011	400	5	5	5	0
1-012	400	3	5		0
1-013	320	3	4	3	0
1-014	320	5	2	4	1
1-015	320	5	5	4	1
1-016	320	5	5	5	1
1-017	320	4	3	4	0
1-018	320	4	4	4	2
1-019	320	5	5	5	4
1-020	320	5	4	4	2
1-021	320	5	5	5	3
1-022	320	5	5	4	2
1-024	320	5	4	4	2
1-025	320	4	3	2	2
1-026	320	5	4	4	4
1-027	320	5	5	5	3
1-029	320	4	5	4	4
1-030	320	5	5	5	4
1-031	320	5	4	3	2
1-032	320	5	5	5	2
1-033	320	5	5	5	1
1-034	320	5	5	5	5
1-035	320	5	5	5	4
1-036	320	5	5	5	4
1-037	320	5	5	5	2
1-038	320	5	5	4	2
1-039	320	3	3	3	2
1-040	320	4	5	4	3
1-041	320	4	5	5	2
1-042	320	5		4	1
1-043	320	5	4	5	5
1-044	320	5	4	4	3
1-045	320	1	3	4	0
1-046	320	5	3	3	3
1-047	320	5	5	4	3
1-048	320	5	4	3	0
1-049	320	5	4	4	1
1-050	320	5	5	5	1
1-051	320	4	5	4	0
1-052	320	4	5	5	0
1-053	320	4	4	4	0

[Tabla 62]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	H	D	E	b
1-054	320	5	5	5	3
1-055	320	5	4	5	2
1-056	320	5	5	5	4
1-057	320	5	5	5	3
1-058	320	5	5	5	4
1-059	320	0	3	3	0
1-060	320	5	4	3	2
1-061	320	5	4	3	1
1-062	320	5	4	4	2
1-063	320	5	5	5	2
1-064	320	5	4	4	2
1-065	320	3	1	3	0
1-066	320	1	4	3	0
1-067	320	5	5	5	2
1-068	320	5	5	5	1
1-069	320	5	5	5	1
1-070	320	4	5	5	0
1-071	320	0	3	5	0
1-072	320	2	1	0	0
1-073	320	5	5	5	4
1-074	320	5	4	3	0
1-075	320	5	4	4	1
1-076	320	5	5	5	3
1-077	320	5	4	3	0
1-078	320	5	5	5	5
1-079	320	5	5	5	5
1-080	320	5	5	5	5
1-081	320	2	0	0	0
1-082	320	4	4	4	0
1-083	320	5	5	5	2
1-084	320	5	5	5	2
1-085	320	5	5	5	3
1-086	320	5	5	5	0
1-087	320	5	5	5	1
1-089	224	3	3	2	0
1-090	320	5	5	5	0
1-091	320	5	5	5	0
1-092	320	5	5	5	4
1-093	320	4	5	4	1
1-094	320	5	4	4	1
1-095	320	4	4	4	1
1-096	320	5	5	4	4
1-100	320	5	5	4	0
1-101	320	1	0	0	0
1-102	320	4	5	4	2
1-103	320	5	5	5	4
1-104	320	5	5	4	0

[Tabla 63]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	H	D	E	b
1-105	320	5	5	5	0
1-106	320	5	5	5	3
1-107	320	5	5	5	3
1-108	320	5	5	5	1
1-109	320	5	5	3	2
1-110	320	5	5	5	5
1-112	320	3	2	1	0
1-113	320	4	3	3	0
1-114	320	4	4	2	0
1-115	320	5	4	4	0
1-116	320	4	4	0	0
1-117	320	4	4	2	0
1-118	320	5	5	3	3
1-119	320	5	5	2	3
1-120	320	5	5	5	3
1-121	320	5	5	5	3
1-122	320	5	5	5	3
1-123	320	4	4	4	1
1-124	320	4	4	4	0
1-125	320	5	4	3	1
1-126	320	4	4	4	0
1-127	320	4	4	3	0
1-128	288	4	3	3	0
1-129	320	5	5	4	3
1-130	320	5	4	2	2
1-131	320	4	4	3	2
1-132	320	5	5	4	3
1-133	320	4	2	0	0
1-134	320	5	4	2	2
1-135	320	5	4	2	1
1-136	320	4	4	0	2
1-137	320	5	5	4	3
1-138	320	5	5	4	3
1-139	320	4	5	5	1
1-141	320	4	2	3	1
1-142	320	3	1	0	0
1-143	320	4	2	4	0
1-144	320	5	4	2	
1-145	320	5	5	5	
1-146	320	5	5	4	
1-147	320	5	5	3	
1-148	320	5	5	5	
1-149	320	5	5	5	
1-150	320	5	5	5	
1-151	320	5	4	4	
1-152	320	5	5	4	
1-153	320	5	5	3	

[Tabla 64]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	H	D	E	b
1-154	320	3	2	4	
1-155	320	1	2	5	
1-156	320	3	2	2	
1-157	320	4	3	4	
1-158	320	5	4	4	
1-159	320	5	3	0	
1-162	320	4	4	2	
1-163	320	5	5	4	
1-164	320	5	5	4	
1-165	320	5	4		0
1-166	320	4	3		2
1-167	320	1	2		
1-168	320	4	3		3
1-169	320	5	4		1
1-170	320	2	4		1
1-171	320	4	4		0
1-172	320	5	5		3
1-173	320	5	4		2
1-174	320	2	2		0
2-001	320	4	4	3	1
2-002	320	5	4	2	2
2-003	200	5	5	5	0
2-005	320	5	5	4	2
2-006	320	5	5	5	5
2-007	320	5	5	5	4
2-008	320	4	5	4	0
2-009	320	5	4	3	4
2-010	320	5	5	5	5
2-011	320	5	5	5	5
2-012	320	4	5	5	2
2-013	320	5	5	5	5
2-014	320	5	5	5	5
2-015	320	5	5	5	4
2-016	320	5	5	5	5
2-017	320	5	5	5	5
2-019	320	5	5	5	5
2-020	320	4	4	4	4
2-021	320	5	5	5	5
2-022	320	5	5	5	5
2-023	320	4	1	0	1
2-024	320	5	5	5	5
2-025	320	5	5	5	5
2-026	320	5	5	5	5
2-027	320	5	5	5	5
2-028	320	5	5	5	5
2-029	320	5	5	5	5
2-030	320	4	5	4	5

[Tabla 65]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	H	D	E	b
2-031	320	5	5	5	5
2-032	320	5	5	5	5
2-033	320	5	5	5	5
2-034	320	5	5	5	5
2-035	320	5	5	4	5
2-036	320	4	5	4	1
2-037	320	5	5	5	5
2-038	320	5	5	5	5
2-039	320	5		5	4
2-040	320	4		5	4
2-041	320	5	5	5	3
2-042	320	5	5	5	5
2-043	320	5	5	5	5
2-044	320	5	5	5	5
2-045	320	5	5	5	5
2-046	320	2	3	3	0
2-047	320	4	5	5	3
2-048	320	5	5	5	3
2-049	320	5	5	5	1
2-050	192	4	3	3	0
2-051	320	5	5	5	4
2-052	320	5	5	5	5
2-053	320	5	5	5	5
2-054	320	5	5	5	5
2-055	131	2	0	0	0
2-056	320	4	5	4	4
2-057	320	5	5	5	5
2-058	320	5	5	5	5
2-059	320	5	5	5	5
2-060	320	5	5	5	5
2-061	320	5	5	5	5
2-062	320	5	5	5	5
2-063	320	5	5	5	3
2-064	320	1	4	5	0
2-065	320	5	5	5	3
2-066	320	5	5	5	3
2-067	320	5	5	5	5
2-068	320	5	5	5	5
2-069	320	5	5	5	5
2-070	320	5	5	5	3
2-071	320	4	5	5	3
2-072	320	4	5	5	1
2-073	320	4	3	5	2
2-074	320	5	5	4	5
2-075	320	5	5	5	5
2-076	320	5	4	4	1
2-077	320	2	4	3	0

[Tabla 66]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	H	D	E	b
2-078	320	5	5	3	4
2-079	320	5	5	5	5
2-080	320	4	5	5	3
2-081	320	5	5	5	4
2-082	320	5	5	5	5
2-083	320	4	4	5	0
2-084	320	5	5	5	5
2-085	320	5	5	4	4
2-086	320	5	5	4	3
2-087	320	5	5	5	3
2-088	141	5	5	4	3
2-089	320	4	5	4	2
2-090	320	5	4	5	
2-091	320	5	3	4	
2-092	320	2	3	2	
2-093	320	1	2	5	
2-094	320	5	5	5	
2-095	320	5	5	5	
2-096	320	0	0	5	
2-097	320	2	3	4	
2-098	320	5	5	5	
2-099	320	5	5		4
2-100	320	5	5		3
2-101	320	5	5		4
2-102	320	5	4		1
2-103	320	5	5		1
2-105	320	5	4		5
2-106	320	1	2		0
2-107	320	4	5		4
2-108	320	4	5		4
2-109	260	3	5		2
2-110	320	5	5		3
3-002	320	0	3		0
4-002	320	0	4	0	0
4-003	320	4	3	0	
5-001	320	1	0	0	0
6-002	320	5	5	4	0
6-003	320	1	5	0	0
6-004	320	4	5	2	3
7-001	320	1	2		
7-002	320	4	4	4	0

[0292] [Vigésima Tabla]

[Tabla 67]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
1-001	320	4	3	4	1	1	1	1	3	3	5	4	4	4	0	0	3	1	4	4
1-002	320	4	2	5	3	1	2	1	3	3	5	5	4		0	0	3	1	5	4
1-004	320	5	4	5	2	2	2	3	4	4	5	5	1	4	0	4	4	2	4	3
1-005	320	3	3	4	1	0	0	0	4	3	5	1	0	3	0	1	0	0	0	0
1-008	320	3	1	5	0	0	0	0	0	2	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0
1-010	320	3	3	4	3	2	1	2	5	5	5	5	1	5	0	1	4	1	5	3
1-011	320	5	4	5	1	1	1	2	5	5	5	5	2	5	0	3	4	0	5	3
1-012	320	3	4	4	0	0	1	1	3	3	5	4	2	4	0	1	2	0	3	4
1-013	320	3	1	4	0	1	1	0	3	3	5	4	1	3	0	0	0	1	3	0
1-014	320	3	3	4	1	1	1	0	4	5	5	5	3	4	1	0	3	1	5	2
1-015	320	4	3	5	3	1	1	3	5	5	5	5	3	5	0	1	4	2	5	4
1-016	320	4	2	5	1	1	1	0	5	5	5	5	2	4	0	0	0	0	5	3
1-017	320	3	0	5	0	0	0	0	5	5	5	4	0	4	0	0	3	0	5	3
1-018	320	0	2	1	0	0	0	0	3	4	5	4	0	4	0	0	0	0	1	0
1-019	320	5	4	5	3	2	2	4	4	5	5	5	4	4	2	2	4	3	5	4
1-020	320	4	3	5	1	1	1	1	2	4	5	4	3	3	0	1	0	1	5	3
1-021	320	4	3	4	1	1	1	1	5	5	5	5	3	4	1	0	3	1	5	3
1-022	320	4	3	5	1	1	1	1	5	5	5	4	2	4	0	2	3	1	4	2
1-024	320	4	3	4	1	0	0	1	4	5	5	4	3	4	0	2	4	0	4	4
1-025	320	3	2	4	0	0	0	0	5	3	5	4	3	3	0	0	3	0	5	2
1-026	320	3	3	3	1	1	1	2	3	4	5	5	2	5	0	0	3	1	5	3
1-027	320	5	4	5	2	2	1	3	5	5	5	5	3	5	0	1	5	2	5	4
1-029	320	5	4	5	1	1	1	1	5	5	5	5	0	5	3	1	3	1	5	1
1-030	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	4	3	2	5	3	5	4
1-031	320	4	4	5	2	1	1	1	5	4	5	4	3	4	0	1	3	1	3	3
1-032	320	5	5	5	2	1	1	2	5	5	5	5	2	4	0	0	4	1	5	4
1-033	320	5	5	5	2	1	1	2	5	5	5	5	3	5	0	2	3	1	5	4
1-034	320	5	5	5	3	1	3	3	5	5	5	5	3	5	5	1	4	2	5	4
1-035	320	5	5	5	2	2	2	3	5	5	5	5	2	5	4	3	4	2	5	3
1-036	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	3	3	4	3	5	5
1-037	320	5	4	4	3	2	2	3	5	5	5	4	4	5	0	1	3	3	5	4
1-038	320	5	5	5	3	1	1	2	5	5	5	5	3	5	0	0	4	1	5	4
1-039	320	2	0	4	0	0	0	0	0	1	4	0	0	0	0	0	0	0	2	0
1-040	320	5	4	4	3	3	3	4	5	5	5	5	3	5	0	0	1	3	5	1
1-041	320	5	4	5	3	1	2	4	5	5	5	5	3	4	0	0	2	3	5	0
1-042	320	4	3	5	2	0	0	2	4	4	5	4	3	4	0	1	3	0	5	3
1-043	320	4	3	5	2	1	1	1	5	5	5	4	3	4	4	2	2	0	5	3
1-044	320	4	4	5	1	1	2	4	5	5	5	4	3	5	0	0	3	0	5	4
1-045	320	3	1	2	0	0	0	0	4	4	5	2	2	3	0	0	1	0	3	3
1-046	320	5	5	5	1	0	0	1	5	5	5	4	2	4	1	2	3	0	5	4
1-047	320	4	4	5	1	0	0	1	5	5	5	4	2	4	0	1	3	0	5	4
1-048	320	5	3	5	2	1	1	2	5	4	5	4	3	4	0	0	4	1	5	4
1-049	320	5	4	5	0	2	2	3	5	5	5	4	3	4	0	4	3	1	5	4
1-050	320	5	4	5	3	2	3	3	5	5	5	5	2	5	1	3	4	3	5	5
1-051	320	3	3	4	1	0	1	1	5	3	5	3	2	3	0	0	1	1	3	1
1-052	320	3	1	2	0	1	1	3	4	4	5	2	1	3	0	0	2	0	3	3
1-053	320	3	2	3	1	0	0	0	4	4	5	2	2	4	0	0	3	0	3	1

[Tabla 68]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
1-054	320	5	4	5	3	3	3	3	5	5	5	4	4	5	0	1	3	3	4	4
1-055	320	4	3	4	1	3	2	3	5	5	5	5	2	4	0	0	3	1	5	4
1-056	320	5	5	5	3	2	2	3	5	5	5	5	4	5	4	4	4	1	5	5
1-057	320	4	4	4	3	2	2	2	5	5	5	5	1	5	0	1	3	0	5	3
1-058	320	5	5	5	3	3	3	2	5	5	5	5	2	5	5	4	4	1	5	4
1-059	320	0	0	2	0	0	0	0	4	2	5	2	0	2	0	0	0	0	0	0
1-060	320	5	3	5	3	2	2	1	4	4	5	4	3	5	3	0	4	3	5	4
1-061	320	3	3	4	3	1	1	1	5	5	5	4	4	5	1	1	4	0	4	4
1-062	320	5	3	5	3	1	0	1	5	4	5	4	4	4	3	0	3	2	4	4
1-063	320	5	5	5	2	2	2	3	4	4	5	4	3	5	0	3	4	2	5	3
1-064	320	5	4	5	1	1	1	1	3	4			3	3	0	0	3	0	4	3
1-065	320	4	1	1	1	0	0	0	3	3	5	4	0	3	0	0	3	0	4	2
1-066	320	3	1	4	1	0	0	0	3	1	5	4	1	4	0	0	3	0	4	0
1-067	320	5	4	5	1	0	0	0	4	1	5	4	3	4	2	0	3	0	4	4
1-068	320	5	4	5	1	1	1	1	3	3	5	4	3	4	2	0	3	1	4	4
1-069	320	5	5	5	2	2	2	4	3	3	5		3		0	1	3	1	5	3
1-070	320	4	4	5	1	0	0	0	4	4	5	5	3		0	0	4	0	4	3
1-071	320	1	0	0	0	0	0	0	3	2	5		1	3	0	0	0	0	2	0
1-072	320	0	0	3	0	0	0	0	1	0	4	2	0	1	0	0	0	0	0	0
1-073	320	5	5	5	3	2	3	3	5	5	5	5	2		5	0	4	3	5	3
1-074	320	4	4	5	1	0	0	0		4	5	4	3	3	0	0	3	0	4	3
1-075	320	3	1	3	0	0	0	0	1	2	5	3	0	3	0	0	0	0	1	1
1-076	320	5	5	5	3	3	3	4	4	4	5	5	2	4	0	3	3	3	5	4
1-077	320	4	2	4	0	0	0	0	2	3	5	4	1	3	0	0	3	0	3	3
1-078	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	4			4	4	4	4	5	4
1-079	320	5	5	5	4	2	3		5	5	5	5	4		4	1	5	4	5	5
1-080	320	5	5	5	4	5	4	5	5	5	5		5		4	4	5	5	5	5
1-081	320	0	0	0	0	0	0	0	0	0	4	2		0	0	0	0	0	1	0
1-082	320	4	3	4	0	0	1	1	4	3	5		0	4	0	0	3	0		0
1-083	320	5	5	5	3	0	1	0	5	5	5	4	4	4	1	1	4	1	5	4
1-084	320	5	5	5	3	0	0	0	5	5	5	4	4	5	3	1	4	0	4	4
1-085	320	5	5	5		3	3	3	5	5	5	4	4	5	3	3	4	3	4	4
1-086	320	5	4	5	0	0	0	0	5	4	5	5	1	4	1	1	1	0	5	4
1-087	320	5	5	5	3	3	1	2	5	5	5	4	1	4	0	4	4	2	5	4
1-088	320	0	0	0	0	0	0	0	0	1	2	0	0	0	0	0	0	0	0	0
1-089	224	1	0	3	2	0	0	0	2	1	4	4	0	3	0	0	1	0	3	1
1-090	320	5	3	5	3	1	1	1	3		5	4	1	5	0	1	4	0	5	4
1-091	320	5	5	5	4	2	3	3	5	5	5	5	4	5	0	2	4	3	5	5
1-092	320	5	5	5	2	1	1	1	4	4	5	5	3	5	5	1	4	0	5	3
1-093	320	5	3	5	1	0	1	1	4	4	5	4	1	4	0	4	3	0	5	3
1-094	320	5	4	5	2	1	1	1	4	4	5	5	0	4	0	4	3	1	5	3
1-095	320	5	3	5	1	1	2	1	4	4	5	5	3	5	0	2	3	1	5	3
1-096	320	5	5	5	2	1	2	3	4	5	5	4	4	5	4	4	4	1	5	5
1-100	320	3	1	4	1	0	0	0	3	1	5	3	0	1	0	0	1	0	3	0
1-102	320	3	3	4	0	0	0	0	3	4	5	4	2	4	0	0	1	0	4	2
1-103	320	5	5	5	4	2	3	3	4	5	5	5	4	5	1	2	4	3	5	5
1-104	320	5	5	5	4	1	1	2	4	4	5	5	3	4	0	3	4	2	4	4

[Tabla 69]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
1-105	320	4	1	4	1	1	1	1	3	3	5	4	1	3	0	1	2	1	4	3
1-106	320	5	5	5	4	1	3	3	4	5	5	5	4	5	3	1	3	3	5	4
1-107	320	5	5	5	4	3	3	3	4	5	5	5	4	5	4	1	5	3	5	5
1-108	320	5	5	5	2	1	2	2	4	5	5	5	3	5	1	1	4	1	5	3
1-109	320	4	3	5	1	0	0	0	4	4	5	4	2	4	0	1	3	0	4	4
1-110	320	5	5	5	4	3	3	3	4	5	5	5	4	5	4	4	4	3	5	5
1-112	320	1	0	2	0	0	0	0	3	4	5	4	0	5	0	0	3	0	5	3
1-113	320	1	0	2	0	0	0	0	1	3	5	4	0	3	0	0	0	0	3	0
1-114	320	1	0	3	0	0	0	0	2	3	5	4	1	3	0	0	0	0	4	0
1-115	320	5	5	5	2	2	1	2	3	4	5	4	3	4	0	0	2	2	5	1
1-116	320	5	4	5	3	1	1	1	4	4	5	5	3	4	0	0	3	2	5	4
1-117	320	1	1	4	0	0	0	0	3	3	5	3	1	3	0	0	3	0	3	1
1-118	320	5	5	5	3	1	1	3	4	4	5	4	4	5	4	0	4	1	5	5
1-119	320	5	4	5	3	3	2	3	5	5	5	4	4	5	3	2	4	3	5	5
1-120	320	5	5	5	3	3	3	5	4	5	5	5	5	5	2	0	4	3	5	5
1-121	320	5	4	5	3	3	3	3	4	5	5	5	3	5	2	2	4	3	5	5
1-122	320	5	5	5	2	3	3	4	5	5	5	5	4	5		2	5	2	5	5
1-123	320	4	3	4	1	0	0	0	4	4	5	4	2	3		0	3	0	4	3
1-124	320	5	3	5	2	0	0	1	5	4	5	3	2	2		1	3	0	3	0
1-125	320	4	1	4	1	0	0	0	3	3	5	4	0	0		2	3	1	5	3
1-126	320	4	3	5	0	0	0	1	3	3	5	5	1	4		1	2	0	5	3
1-127	320	1	1	4	0	0	0	0	2	1	5	3	0	1		0	1	0	2	0
1-128	288	5	2	5	0	1	1	1	3	3	5	5	1	5		0	3	1	5	3
1-129	320	4	4	5	2	1	1	1	3	4	5	5	0			2	4	1	5	3
1-130	320	4	4	5	1	1	1	1	3	3	5	3	4	3		0	3	0	5	4
1-131	320	4	3	4	0	0	0	0	3	3	5	3	0	3		0	3	0	3	0
1-132	320	4	3	5	1	1	1	2	4	3	5		2	4		2	3	1	5	4
1-133	320	3	0	4	0	0	0	0	3	3	4	4	1	2		0	3	0	3	0
1-134	320	4	3	5	0	1	1	1	4	3	5	4	3	4		0	3	1	5	4
1-135	320	4	3	4	1	1	1	1	3	3	5	4	0	1		0	3	0	4	0
1-136	320	4	2	4	0	0	0	1	3	2	5	4	0	3		1	3	0	4	0
1-137	320	4	5	5	3	2	2	4	3	4	5	5	3	5		0	4	2	5	5
1-138	320	4	3	5	2	1	1	3	3	4	5	5	2	5		0	3	1	5	4
1-139	320	5	3	5	1	0	1	0	3	4	5	5	2	5		0	3	1	5	4
1-141	320	3	1	4	0	0	0	0	3	3	4	3	1	3		0	1	0	4	4
1-142	320	1	0	3	0	0	0	0	0	1	4	2	1	0		0	0	0	3	0
1-143	320	2	0	4	0	0	0	0	2	2	4	3	2	3		0	1	0	2	3
1-144	320	3	2	5	2	1	1	0	2	4	5	5	3	4	0	0	4	1	5	4
1-145	320	5	4	5	3	1	2	3	3	4	5	5	1	5	3	0	3	2	5	3
1-146	320	5	5	5	4	2	4	4	4	5	5	5	5	5	5	0	5	3	5	5
1-147	320	4	3	4	3	2	3	3	3	4	5	5	3	5	0	0	3	3	5	5
1-148	320	4	3	5	1	1	3	2	3	5	5	5	4	5	3	0	3	0	5	4
1-149	320	4	3	4	1	1	1	2	3	3	5	5	3	5	1	0	3	0	5	5
1-150	320	4	3	5	3	1	3	3	3	5	5	5	4	5	3	0	4	3	5	5
1-151	320	5	3	5	3	1	3	2	3	5	5	5	4	5	0	0	4	3	5	5
1-152	320	4	3	4	2	0	1	1	3	4	5	4	1	3	0	0	3	0	4	1
1-153	320	4	4	5	3	1	1	2	3	4	5	5	4	4	3	0	5	2	5	3

[Tabla 70]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
1-154	320	3	2	3	0	0	0	0	2	2	5	4	0	0	0	0	2	0	4	0
1-155	320	3	1	3	0	0	0	0	3	3	5		0	2	0	0	3	0	5	0
1-156	320	2	1	4	1	1	1	2	3	3	5	4	1	3	0	0	3	1	3	0
1-157	320	3	1	3	1	1	1	1	3	3	5		1	2	0	0	3	1	4	2
1-158	320	5	4	5	3	1	2	3	4	4	5	5	3	4	0	0	4	2	5	3
1-159	320	4	4	5	2	1	2	2	3	3	5	5	2	3	0	0	3	1	4	1
1-160	320	1	0	2	0	0	0	0	3	1	4	3	0	1	0	0	2	0	2	0
1-161	320	3	0	3	0	0	0	0	1	0	4	0	0	1	0	0	1	0	1	0
1-162	320	3	1	4	1	1	1	0	3	4	4	3	2	3	0	0	3	0	3	1
1-163	320	4	3	5	2	1	1	1	4	4	5	4	3	2	0	0	4	1	4	3
1-164	320	5	5	5	3	1	1	3	4	5	5		4		4	0	5	3	5	4
1-165	320	3	1	4	0	0	0	2	3	4	5	4	2	4	0	0	1	0	5	4
1-166	320	5	4	5	1	0	1	1	3	4	5	4	1		0	0	4	0	5	4
1-167	320	0	0	2	1	0	1	1	2	2	5	5	2	4	0	0	1	0	5	0
1-168	320	5	4	5	1	0	1	0	3	3	5	5	1	5	3	0	3	1	5	3
1-169	320	4	3	5	1	1	1	1	3		5	5	1	4	0	1	5	1	5	0
1-170	320	4	3	4	1	0	1	1	3	3	5	4	2	4	0	0	2	0	5	3
1-171	320	3	3	5	0	0	0	1	4	4	5	5	2	3	0	0	3	0	5	3
1-172	320	5	4	5	2	1	1	1	5	5	5	5	4	4	3	0	4	1	5	4
1-173	320	4	3	5	2	1	1	1	5	5	5	5	4	4	3	0	4	1	5	4
1-174	320	0	0	0	0	0	0	0	0	4	5	3	3	3	0	0	0	0	4	0
2-001	320	3	0	4	1	0	1	0	5	5	5	5	4	5	0	0	2	0	5	4
2-002	320	4	3	5	3	1	1	1	5	5	5	5	4	5	2	0	3	1	5	4
2-003	320	5	5	5	3	3	3	5	5	5	5	5	4	5	4	1	4	3	5	5
2-005	320	5	4	5	3	3	2	4	5	5	5	5	4	5	0	1	3	3	5	4
2-006	320	5	5	5	3	2	1	4	5	5	5	5	3	5	5	1	4	3	5	4
2-007	320	5	4	5	3	2	2	4	5	5	5	5	1	5	2	0	3	2	5	4
2-008	320	3	2	4	3	1	2	1	5	5	5	5	3	4	1	0	3	2	5	3
2-009	320	4	3	5	3	1	2	1	5	5	5	5	4	4	2	1	4	1	5	4
2-010	320	4	3	5	4	3	3	2	5	5	5	5	4	5	5	3	4	3	5	5
2-011	320	5	3	5	3	3	2	3	5	5	5	5	3	5	5	1	4	1	5	1
2-012	320	4	1	4	3	2	2	2	5	5	5	5	4	4	5	3	4	4	5	4
2-013	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	4	5	3	4	4	5	4
2-014	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	4	5	5	3	4	4	5	4
2-015	320	5	4	5	2	2	2	2	5	5	5	4	3	3	4	2	2	2	4	3
2-016	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	3	5	5	1	4	4	5	4
2-017	320	5	5	5	4	3	2	4	5	5	5	5	1	5	5	1	4	3	5	4
2-018	320	2	1	1	0	0	0	0	3	3	3	0	1	2	0	0	0	0	1	0
2-019	320	5	5	5	3	2	2	4	5	5	5	5	3	5	4	0	4	3	5	4
2-020	320	3	3	3	1	0	1	1	5	4	5	4	2	4	2	0	3	1	5	3
2-021	320	5	5	5	3	3	3	4	5	5	5	5	4	5	4	0	4	3	5	4
2-022	320	4	5	5	4	3	3	5	5	5	5	5	4	5	5	1	5	3	5	5
2-023	320	1	1	4	0	0	0	0	3	5	4	3		4	0	0	1	0	4	1
2-024	320	5	5	5	4	3	4	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5	4	5	5
2-025	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	5	1	4	3	5	4
2-026	320	5	4	5	3	4	3	3	5	5	5	5	4	5	5	2	5	3	5	5
2-027	320	5	5	5	3	4	3	4	5	5	5	5	4	5	4	0	1	3	5	4

[Tabla 71]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
2-028	320	5	5	5	4	4	4	5	5	5	5	5	4	5	5	3	4	4	5	5
2-029	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	5	5	5	5
2-030	320	5	5	5	4	3	3	5	5	5	5	5	3	5	5	0	4	3	5	5
2-031	320	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2-032	320	5	5	5	5	3	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2-033	320	5	5	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5	5
2-034	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5
2-035	320	5	5	5	4	3	4	4	5	5	5	5	2	5	5	2	4	4	5	5
2-036	320	5	4	5	1	0	0	3	5	5	5	5	4	4	0	0	2	0	5	3
2-037	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5
2-038	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
2-039	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	4	3	4	3	5	5
2-040	320	5	3	5	3	1	1	3	5	5	5	5	4	5	4	1	4	2	5	3
2-041	320	4	3	5	3	3	3	4	5	4	5	5	4	4	2	0	4	3	5	4
2-042	320	5	5	5	2	2	1	0	5	5	5	3	1	5	4	0	3	0	4	2
2-043	320	5	4	5	4	3	2	4	5	5	5	5	4	5	3	1	4	3	5	4
2-044	320	5	4	5	2	2	2	3	5	5	5	4	3	5	3	2	4	1	5	3
2-045	320	5	4	5	2	1	1	3	5	5	5	5	3	5	4	3	4	1	5	5
2-046	320	0	1	3	0	0	0	0	4	4	4	2	1	1	0	0	0	0	2	0
2-047	320	5	3	5	3	1	1	3	5	5	5	4	3	5	3	0	3	3	5	3
2-048	320	5	5	5	4	3	4	4	5	5	5	4	4		4	4	5	4	5	5
2-049	320	5	5	5	3	1	3	4	4	3	5		3	4	2	1	4	0	4	3
2-050	192	3	1	3	2	0	0	0	3	2	5	3	0	3	0	0	3	0	3	0
2-051	320	5	5	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	4	2	4	4	5	4
2-052	320	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5			5	4	5	5	5	5
2-053	320	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5		5	4	5	5	5	5
2-054	320	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	4		5	5	5	5	5	5
2-055	131	0	0	0	0	0	0	0	4	3	5	4	0		0	0	1	0	1	0
2-056	320	5	3	4	1	1	1	1	4	4	5	5	4		0	1	3	1	5	3
2-057	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	4	5	4	2	5	4	5	5
2-058	320	5	5	5	5	4	4	4	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5
2-059	320	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	5	5	5	5	3	5	4	5	5
2-060	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	5	5	2	4	4	5	5
2-061	320	5	5	5	4	3	4	3	4	5	5	5	3	5	5	3	4	3	5	4
2-062	320	5	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5
2-063	320	5	5	5	4	3	3	3	5	5	5	5	4	5	4	3	4	3	5	4
2-064	320	3	2	3	0	0	0	0	5	5	5	5	1	5	0	0	3	0	4	3
2-065	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	3	5	3	4	4	3	5	4
2-066	320	5	5	5	2	3	3	3	4	5	5	5	3	5	4	1	4	3	5	4
2-067	320	5	5	5	5	4	4	3	5	5	5	5	4	5	5	4	5	4	5	5
2-068	320	5	5	5	3	2	2	3	5	5	5	5	4	5	5	3	4	2	5	4
2-069	320	5	5	5	5	3	3	4	5	5	5	5	4	5	5	4	4	3	5	5
2-070	320	5	5	5	5	4	4	4	4	5	5	5	4	5	3	4	3	4	5	5
2-071	320	5	4	5	2	1	1	1	4	5	5	5	3	5	1	2	3	1	5	4
2-072	320	5	5	5	1	1	1	3	5	5	5	5	3	5	1	3	4	1	5	4
2-073	320	1	1	4	1	0	1	0	3	3	5	4	0	2	0	0	2	0	3	0
2-074	320	5	4	5	4	3	3	3	4	5	5	4	3	5	5	3	4	3	5	4

[Tabla 72]

No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
2-075	320	5	5	5	5	4	4	4	5	5	5	5	4	5	5	3	5	4	5	5
2-076	320	3	3	5	1	1	1	2	4	5	5	5	3	5	1	0	1	0	5	4
2-077	320	4	2	4	0	0	0	0	4	5	5	4	3	3	0	0	2	0	5	2
2-078	320	5	5	5	3	4	4	5	5	5	5	5	4	5	4	1	4	2	5	5
2-079	320	5	5	5	3	4	2	5	5	5	5	5	4	5	5	2	4	2	5	5
2-080	320	5	3	5	1	1	0	3	5	5	5	4	4	5	3	0	4	0	5	5
2-081	320	4	3	5	3	1	1	1	4	5	5	5	3	4		0	3	2	5	4
2-082	320	5	5	5	2	4	4	4	5	5	5	5	4	4		1	5	4	5	5
2-083	320	5	4	5	2	1	1	1	5	5	5	4	3	4		0	4	0	5	1
2-084	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	3		1	3	3	5	3
2-085	320	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	4	4		2	5	3	5	4
2-086	320	5	5	5	3	1	2	4	5	5	5	4	4	5		0	4	2	5	3
2-087	320	5	4	5	4	3	3	4	5	4	5	5	3			0	3	2	5	3
2-088	141	5	5	5	4	3	3	4	5	5	5	5	3	4		0	4	0	5	5
2-089	320	4	4	4	1	2	1	4	4	4	5	5	3	5		0	4	0	5	4
2-090	320	5	4	5	4	3	4	4	3	4		5	4	3	3	1	3	3	5	4
2-091	320	5	5	5	3	2	3	3	4	4	5	5	4	4	2	0	3	3	5	5
2-092	320	0	0	2	1	0	0	0	1	1	3	3	1	1	0	0	1	0	3	0
2-093	320	1	0	1	1	1	1	1	3	2	5	5	2	2	0	0	3	1	2	1
2-094	320	4	4	5	2	1	1	3	5	4	5	5	3	4	3	1	4	1	5	4
2-095	320	5	5	5	4	4	3	5	5	5	5	5	4	4	5	1	5	3	5	5
2-096	320	5	4	5	1	0	0	0	5	5	5	4	3	3	0	0	3	0	5	0
2-097	320	4	3	5	2	1	1	2	3	3	5	4	3	4	0	0	3	0	4	1
2-098	320	5	5	5	4	2	3	4	4	5	5	5	4	4	4	1	4	3	5	4
2-099	320	5	4	5	2	0	1	1	4	4	5	5	4	5	3	0	4	0	5	4
2-100	320	5	4	5	3	2	3	4	5	5	5	5	5	5	5	0	4	0	5	5
2-101	320	5	5	5	3	3	3	4	5	5	5	5	4	5	4	2	5	3	5	5
2-102	320	5	4	5	1	0	1	3	5	5	5	5	3	5	1	0	4	1	5	3
2-103	320	4	3	5	1	0	1	2	4	5	5	5	4	4	2	0	4	0	5	3
2-105	320	5	4	5	4	3	3	4	5	5	5	5	3	5	4	0	4	3	5	5
2-106	320	3	1	3	1	0	0	0	5	4	5	4	3	3	0	0	4	0	5	3
2-107	320	5	3	5	1	0	0	0	5	5	5	5	4	5	3	0	5	0	5	4
2-108	320	4	3	5	1	0	0	0	5	5	5	5	4	5	4	0	4	1	5	5
2-109	256	3	2	4	1	0	1	0	5	5	5	5	3	5	1	0	4	1	5	4
2-110	320	5	4	5	3	2	3	3	5	5	5	5	5	5	4	0	4	3	5	4
3-002	320	0	0	0	0	0	0	0	1	3	4	1	0	0	0	0	0	0	0	0
4-001	320	1	2	3	1	0	0	0	5	5	5	3	3	3	0	0	2	0	2	0
4-002	320	1	1	2	1	0	0	0	5	4	4	3	1	1	0	0	1	0	0	0
4-003	320	2	1	4	0	0	0	1	4	2	5	4	1	2	0	0	4	0	4	1
4-004	320	0	0	0	0	0	0	0	0	0	4	0	0	0	0	0	0	0	0	0
6-001	320	1	2	1	0	0	0	0	3	3	4	4	2	2	0	0	0	0	3	0
6-002	320	4	3	5	1	0	0	0	5	5	5	5	3	4	0	0	3	0	3	3
6-003	320	4	3	3	0	0	0	0	4	2	3	4	1	1	0	0	0	0	1	0
6-004	320	5	4	5	3	1	2	1	5	5	5	4	4	3	0	0	4	1	2	3
6-005	320	3	1	3	0	1	1	1	4	3	3	1	1	1	0	0	0	0	1	0
6-006	320	0	0	0	0	0	0	0	1	0	3	1	0	1	0	0	0	0	0	0
6-007	320	0	0	0	0	0	0	0	2	3	3	0	0	0	0	0	2	0	3	0

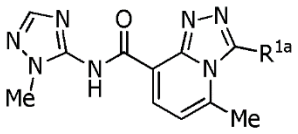
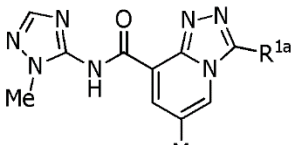
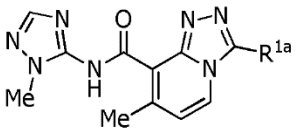
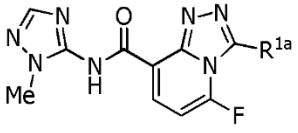
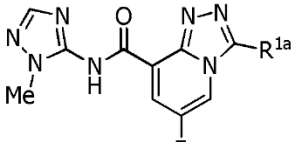
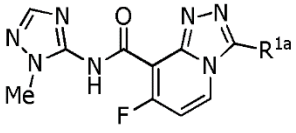
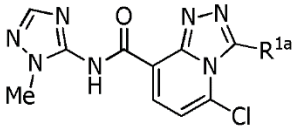
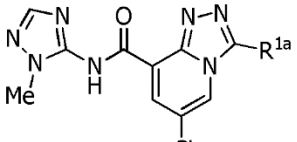
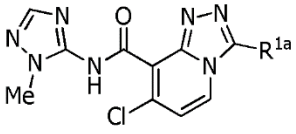
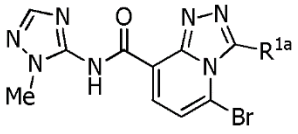
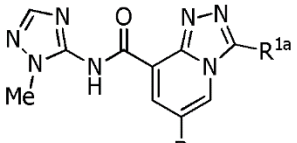
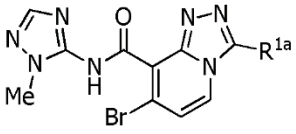
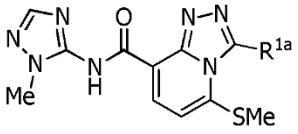
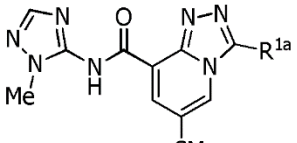
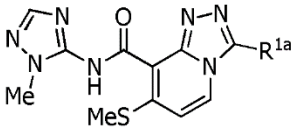
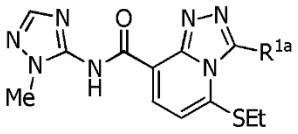
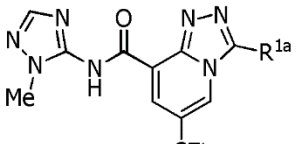
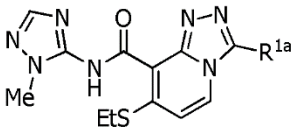
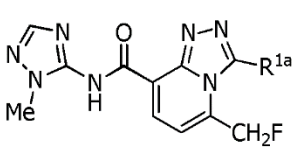
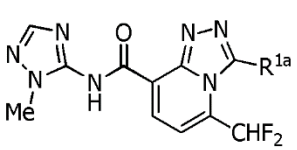
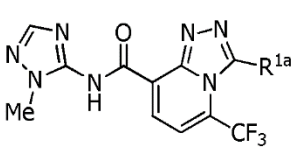
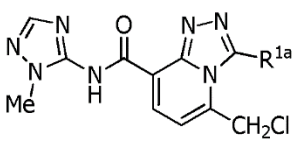
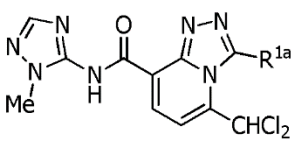
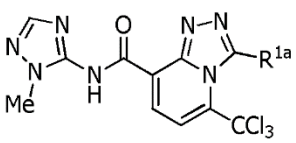
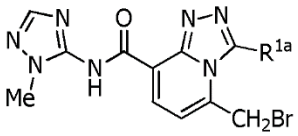
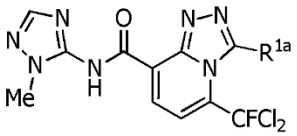
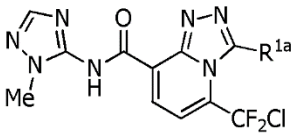
[Tabla 73]

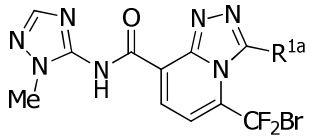
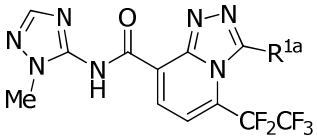
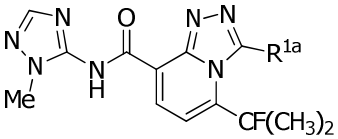
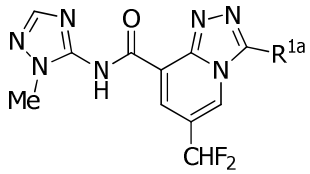
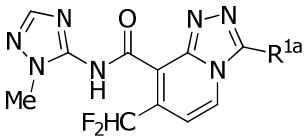
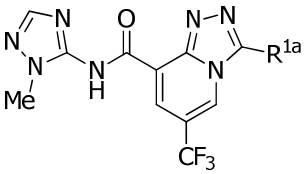
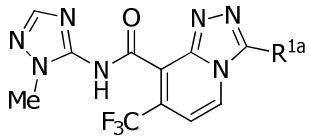
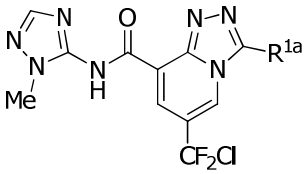
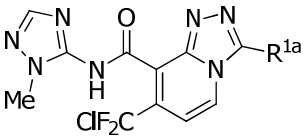
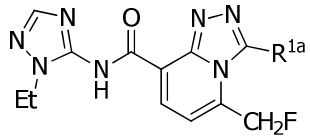
No.	Cantidad Aplicada de Herbicida (g/ha)	F	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	Q	R	b	c	d	e	f	g
6-008	320	0	0	0	0	0	0	0	1	0	3	1	0	0	0	0	1	0	1	0
7-001	320	0	0	1	0	0	0	0	1	0	2	1	0	0	0	0	0	0	0	0
7-002	320	3	2	4	1	0	0	0	3	4	5	4	3	3	0	0	2	0	4	3

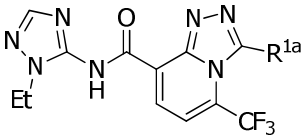
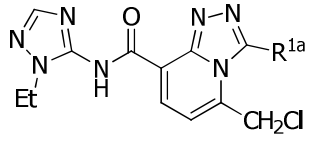
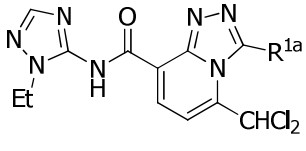
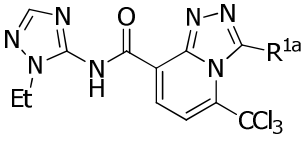
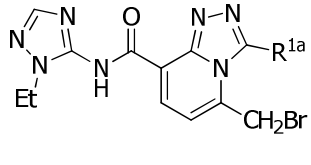
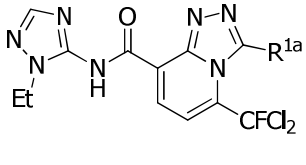
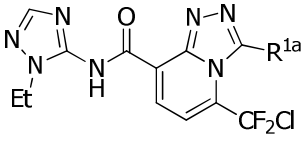
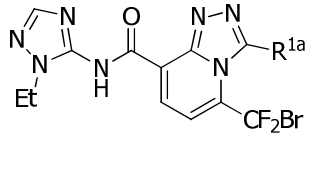
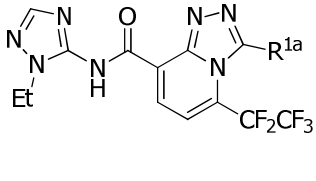
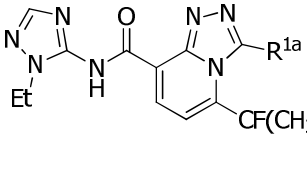
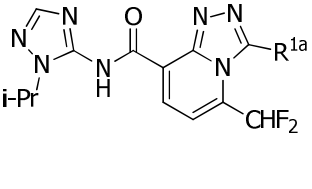
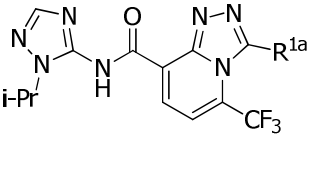
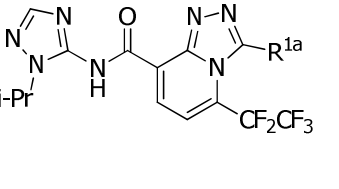
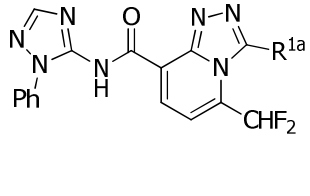
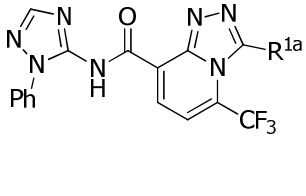
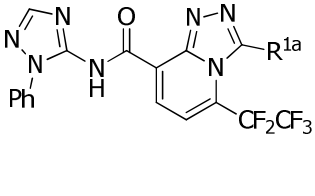
APLICABILIDAD INDUSTRIAL

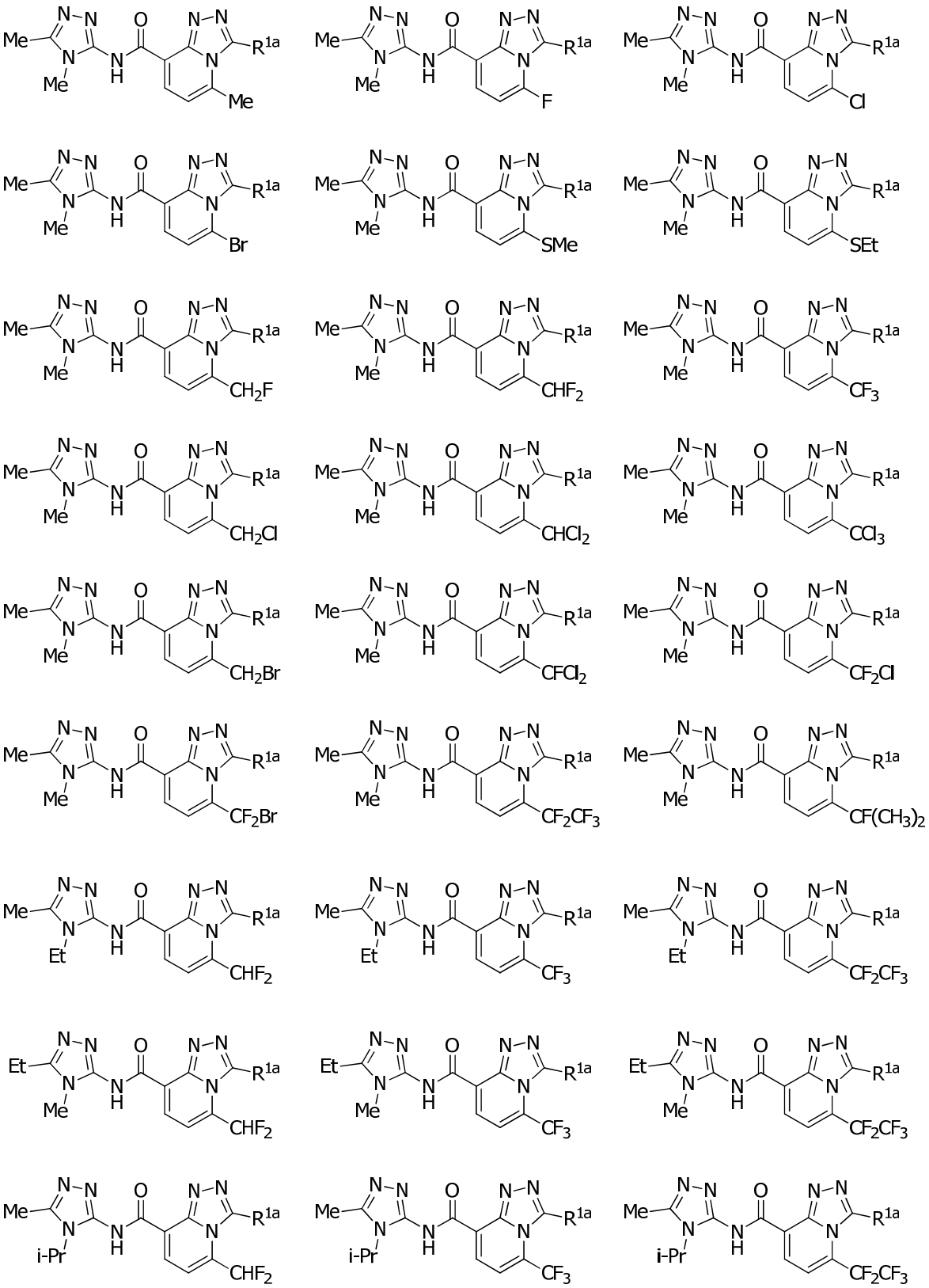
[0293]

El compuesto de amida heterocíclica de la presente invención es un compuesto nuevo y es útil como herbicida selectivo para *Oryza sative*, *Zea mays*, *Glycine max*, *Triticum aestivum*, *Beta vulgaris ssp. vulgaris*, Y *Brassica campestris L.*



[Tabla 1]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
H	CH_2CF_3	$C(Me)_2CH_2CN$
F	$(CH_2)_3Cl$	CH_2Pr-c
Cl	$(CH_2)_3Br$	CH_2(D-16)
Br	$(CH_2)_2CF_3$	CH_2(D-16d)
I	$CHFCH_3$	CH_2Bu-c
Me	CF_2CH_3	CH_2Pen-c
Et	$CF(CH_3)_2$	CH_2Hex-c
Pr-n	CF_2CF_2H	CH(Me)Pr-c
Pr-i	CF_2CF_3	CH(Me)(D-16)
Pr-c	$CF_2CF_2CF_3$	CH(Me)(D-16e)
Bu-n	$CF(CF_3)$	CH(Me)Bu-c
Bu-i	CH(Me)Cl	CH(Me)Pen-c
Bu-c	CH(Me)Br	CH(Me)Hex-c
Bu-s	CH(Et)Cl	$(CH_2)_2Pr-c$
Bu-t	CH(Et)Br	$(CH_2)_2$(D-16)
Pen-n	CH(Pr-n)Cl	$(CH_2)_2$(D-16e)
Pen-i	CH(Pr-n)Br	$(CH_2)_2Bu-c$
Pen-c	CH(Pr-i)Cl	$(CH_2)_2Pen-c$
Pen-s	CH(Pr-i)Br	$(CH_2)_2Hex-c$
Pen-t	$C(Me)_2Cl$	CH_2OMe
3-Pen	$C(Me)_2Br$	CH_2OEt
Hex-n	$CH(Me)CH_2Cl$	CH_2OPr-n
Hex-c	$CH(Me)CH_2Br$	CH_2OPr-i
CH_2Cl	$C(Me)_2CH_2Cl$	CH_2OBu-n
CH_2Br	$C(Me)_2CH_2Br$	CH_2OBu-i
$CHBr_2$	CH_2CN	CH_2OBu-s
CF_2H	$(CH_2)_2CN$	CH_2OBu-t
CF_2Cl	$(CH_2)_3CN$	$CH_2OPen-n$
CF_2Br	CH(Me)CN	$CH_2OPen-i$
CF_3	CH(Et)CN	$CH_2OPen-s$
$(CH_2)_2Cl$	CH(Pr-n)CN	$CH_2OPen-t$
$(CH_2)_2Br$	CH(Pr-i)CN	$CH_2OHex-n$
CH_2CF_2H	$C(Me)_2CN$	CH(Me)OMe
CH_2CF_2Cl	$CH(Me)CH_2CN$	CH(Me)OEt
CH_2CF_2Br	$CH(Et)CH_2CN$	CH(Me)OPr-n

[Tabla 2]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
CH(Me)OPr–i	$C(Me)_2OBu$–n	$CH_2O(CH_2)_2Cl$
CH(Me)OBu–n	$C(Me)_2OBu$–i	$CH_2O(CH_2)_2Br$
CH(Me)OBu–i	$C(Me)_2OBu$–s	$CH(Me)OCF_2H$
CH(Me)OBu–s	$C(Me)_2OBu$–t	$CH(Me)OCF_3$
CH(Me)OBu–t	$(CH_2)_2OMe$	$CH(Me)OCH_2CF_2H$
CH(Me)OPen–n	$(CH_2)_2OEt$	$CH(Me)OCH_2CF_3$
CH(Me)OPen–i	$(CH_2)_2OPr$–n	$CH(Me)O(CH_2)_2CF_3$
CH(Me)OPen–s	$(CH_2)_2OPr$–i	$CH(Me)O(CH_2)_2Cl$
CH(Me)OPen–t	$(CH_2)_2OBu$–n	$CH(Me)O(CH_2)_2Br$
CH(Me)OHex–n	$(CH_2)_2OBu$–i	$CH(Et)OCF_2H$
CH(Et)OMe	$(CH_2)_2OBu$–s	$CH(Et)OCF_3$
CH(Et)OEt	$(CH_2)_2OBu$–t	$CH(Et)OCH_2CF_2H$
CH(Et)OPr–n	$CH(Me)CH_2OMe$	$CH(Et)OCH_2CF_3$
CH(Et)OPr–i	$CH(Me)CH_2OEt$	$CH(Et)O(CH_2)_2CF_3$
CH(Et)OBu–n	$CH(Me)CH_2OPr$–n	$CH(Et)O(CH_2)_2Cl$
CH(Et)OBu–i	$CH(Me)CH_2OPr$–i	$CH(Et)O(CH_2)_2Br$
CH(Et)OBu–s	$CH(Me)CH_2OBu$–n	$C(Me)_2OCF_2H$
CH(Et)OBu–t	$CH(Me)CH_2OBu$–i	$C(Me)_2OCF_3$
CH(Et)OPen–n	$CH(Me)CH_2OBu$–s	$C(Me)_2OCH_2CF_2H$
CH(Et)OPen–i	$CH(Me)CH_2OBu$–t	$C(Me)_2OCH_2CF_3$
CH(Et)OPen–s	$CH(Et)CH_2OMe$	$C(Me)_2O(CH_2)_2CF_3$
CH(Et)OPen–t	$CH(Et)CH_2OEt$	$C(Me)_2O(CH_2)_2Cl$
CH(Et)OHex–n	$(CH_2)_3OMe$	$C(Me)_2O(CH_2)_2Br$
CH(Pr–n)OMe	$(CH_2)_3OEt$	$(CH_2)_2OCF_3$
CH(Pr–n)OEt	$(CH_2)_3OPr$–n	$(CH_2)_2OCH_2CF_2H$
CH(Pr–n)OPr–n	$(CH_2)_3OPr$–i	$(CH_2)_2OCH_2CF_3$
CH(Pr–n)OPr–i	$(CH_2)_3OBu$–n	$(CH_2)_2O(CH_2)_2Cl$
CH(Pr–i)OMe	$(CH_2)_3OBu$–i	$(CH_2)_2O(CH_2)_2Br$
CH(Pr–i)OEt	$(CH_2)_3OBu$–s	CH_2OH
CH(Pr–i)OPr–n	$(CH_2)_3OBu$–t	CH(Me)OH
CH(Pr–i)OPr–i	CH_2OCF_2H	CH(Et)OH
$C(Me)_2OMe$	CH_2OCF_3	CH(iPr)OH
$C(Me)_2OEt$	$CH_2OCH_2CF_2H$	$C(Me)_2OH$
$C(Me)_2OPr$–n	$CH_2OCH_2CF_3$	$(CH_2)_2OH$
$C(Me)_2OPr$–i	$CH_2O(CH_2)_2CF_3$	$CH(Me)CH_2OH$

[Tabla 3]

R^{1a}
$(CH_2)_3OH$
CH_2OCH_2OMe
CH_2OCH_2OEt
CH_2OCH_2OPr–n
CH_2OCH_2OPr–i
$CH_2O(CH_2)_2OMe$
$CH_2O(CH_2)_2OEt$
$CH_2O(CH_2)_2OPr$–n
$CH_2O(CH_2)_2OPr$–i
$CH_2OCH(Me)CH_2OMe$
$CH_2OCH(Me)CH_2OEt$
$CH_2OCH_2CH(Me)OMe$
$CH_2OCH_2CH(Me)OEt$
$CH_2OCH(Me)OMe$
$CH_2OCH(Me)OEt$
$CH_2O(CH_2)_3OMe$
$CH_2O(CH_2)_3OEt$
$CH(Me)OCH_2OMe$
$CH(Me)OCH_2OEt$
$CH(Me)OCH_2OPr$–n
$CH(Me)OCH_2OPr$–i
$CH(Me)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Me)O(CH_2)_2OEt$
$CH(Me)O(CH_2)_2OPr$–n
$CH(Me)O(CH_2)_2OPr$–i
$CH(Me)OCH(Me)CH_2OMe$
$CH(Me)OCH(Me)CH_2OEt$
$CH(Me)OCH_2CH(Me)OMe$
$CH(Me)OCH_2CH(Me)OEt$
$C(Me)_2OCH_2OMe$
$C(Me)_2OCH_2OEt$
$C(Me)_2OCH_2OPr$–n
$C(Me)_2OCH_2OPr$–i
$C(Me)_2O(CH_2)_2OMe$
$C(Me)_2O(CH_2)_2OEt$

R^{1a}
$C(Me)_2O(CH_2)_2OPr$–n
$C(Me)_2O(CH_2)_2OPr$–i
$(CH_2)_2OCH_2OMe$
$(CH_2)_2OCH_2OEt$
$(CH_2)_2OCH_2OPr$–n
$(CH_2)_2OCH_2OPr$–i
$(CH_2)_2O(CH_2)_2OMe$
$(CH_2)_2O(CH_2)_2OEt$
$(CH_2)_2O(CH_2)_2OPr$–n
$(CH_2)_2O(CH_2)_2OPr$–i
$CH(Me)CH_2OCH_2OMe$
$CH(Me)CH_2OCH_2OEt$
$CH(Me)CH_2O(CH_2)_2OMe$
$CH(Me)CH_2O(CH_2)_2OEt$
$CH(Et)CH_2OCH_2OMe$
$CH(Et)CH_2OCH_2OEt$
$CH(Et)CH_2O(CH_2)_2OMe$
$CH(Et)CH_2O(CH_2)_2OEt$
$CH(Et)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Et)O(CH_2)_2OEt$
$CH(Et)O(CH_2)_2OPr$–n
$CH(Et)O(CH_2)_2OPr$–i
$CH(Pr$–n$)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Pr$–n$)O(CH_2)_2OEt$
$CH(Pr$–n$)O(CH_2)_2OPr$–n
$CH(Pr$–n$)O(CH_2)_2OPr$–i
$CH(Pr$–i$)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Pr$–i$)O(CH_2)_2OEt$
$CH(Pr$–i$)O(CH_2)_2OPr$–n
$CH(Pr$–i$)O(CH_2)_2OPr$–i
$CH_2OC(O)Me$
$CH_2OC(O)Et$
$CH_2OC(O)Pr$–i
$CH(Me)OC(O)Me$
$CH(Me)OC(O)Et$

R^{1a}
$CH(Me)OC(O)Pr$–i
$CH(Et)OC(O)Me$
$CH(Et)OC(O)Et$
$CH(Et)OC(O)Pr$–i
CH_2OPh
$CH(Me)OPh$
$CH_2C(O)OH$
$CH_2C(O)OMe$
$CH_2C(O)OEt$
$CH_2C(O)OPr$–n
$CH_2C(O)OPr$–i
$CH_2C(O)OBu$–n
$CH_2C(O)OBu$–i
$CH_2C(O)OBu$–s
$CH_2C(O)OBu$–t
$CH_2C(O)OPen$–n
$CH_2C(O)OPen$–i
$CH_2C(O)OPen$–s
$CH_2C(O)OPen$–t
$CH_2C(O)OHex$–n
$CH_2C(O)OCH_2OMe$
$CH_2C(O)O(CH_2)_2OMe$
$CH_2C(O)O(CH_2)_2OEt$
$CH_2C(O)O(CH_2)_2OPr$–i
$CH_2C(O)NHMe$
$CH_2C(O)NHEt$
$CH_2C(O)NHPr$–n
$CH_2C(O)NHPr$–i
$CH(Me)C(O)OH$
$CH(Me)C(O)OMe$
$CH(Me)C(O)OEt$
$CH(Me)C(O)OPr$–i
$CH(Me)C(O)OCH_2OMe$
$CH(Me)C(O)O(CH_2)_2OMe$
$CH(Me)C(O)O(CH_2)_2OEt$

[Taba 4]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
CH(Me)C(O)O(CH$_2$)$_2$OPr–i	CH$_2$S(O)$_2$Pr–i	CH(Me)SPr–i
CH(Me)C(O)NHMe	CH$_2$SBu–n	CH(Me)S(O)Pr–i
CH(Me)C(O)NHEt	CH$_2$S(O)Bu–n	CH(Me)S(O)$_2$Pr–i
CH(Me)C(O)NHPr–n	CH$_2$S(O)$_2$Bu–n	CH(Me)SBu–n
CH(Me)C(O)NHPr–i	CH$_2$SBu–i	CH(Me)S(O)Bu–n
CH(Et)C(O)OH	CH$_2$S(O)Bu–i	CH(Me)S(O)$_2$Bu–n
CH(Et)C(O)OMe	CH$_2$S(O)$_2$Bu–i	CH(Me)SBu–i
CH(Et)C(O)OEt	CH$_2$SBu–s	CH(Me)S(O)Bu–i
CH(Et)C(O)OPr–i	CH$_2$S(O)Bu–s	CH(Me)S(O)$_2$Bu–i
CH(Et)C(O)OCH$_2$OMe	CH$_2$S(O)$_2$Bu–s	CH(Me)SBu–s
CH(Et)C(O)O(CH$_2$)$_2$OMe	CH$_2$SBu–t	CH(Me)S(O)Bu–s
CH(Et)C(O)O(CH$_2$)$_2$OEt	CH$_2$S(O)Bu–t	CH(Me)S(O)$_2$Bu–s
CH(Et)C(O)O(CH$_2$)$_2$OPr–i	CH$_2$S(O)$_2$Bu–t	CH(Me)SBu–t
CH(Et)C(O)NHMe	CH$_2$SPen–n	CH(Me)S(O)Bu–t
CH(Et)C(O)NHEt	CH$_2$S(O)Pen–n	CH(Me)S(O)$_2$Bu–t
(CH$_2$)$_2$C(O)OH	CH$_2$S(O)$_2$Pen–n	CH(Me)SPen–n
(CH$_2$)$_2$C(O)OMe	CH$_2$SPen–i	CH(Me)S(O)Pen–n
(CH$_2$)$_2$C(O)OEt	CH$_2$S(O)Pen–i	CH(Me)S(O)$_2$Pen–n
(CH$_2$)$_2$C(O)O(CH$_2$)$_2$OMe	CH$_2$S(O)$_2$Pen–i	CH(Me)SPen–i
(CH$_2$)$_2$C(O)O(CH$_2$)$_2$OEt	CH$_2$SPen–s	CH(Me)S(O)Pen–i
(CH$_2$)$_2$C(O)NHMe	CH$_2$S(O)Pen–s	CH(Me)S(O)$_2$Pen–i
(CH$_2$)$_2$C(O)NHEt	CH$_2$S(O)$_2$Pen–s	CH(Me)SPen–s
(CH$_2$)$_2$C(O)NHPr–n	CH$_2$SPen–t	CH(Me)S(O)Pen–s
(CH$_2$)$_2$C(O)NHPr–i	CH$_2$S(O)Pen–t	CH(Me)S(O)$_2$Pen–s
CH$_2$SMe	CH$_2$S(O)$_2$Pen–t	CH(Me)SPen–t
CH$_2$S(O)Me	CH$_2$SHex–n	CH(Me)S(O)Pen–t
CH$_2$S(O)$_2$Me	CH(Me)SMe	CH(Me)S(O)$_2$Pen–t
CH$_2$SEt	CH(Me)S(O)Me	CH(Me)SHex–n
CH$_2$S(O)Et	CH(Me)S(O)$_2$Me	C(Me)$_2$SMe
CH$_2$S(O)$_2$Et	CH(Me)SEt	C(Me)$_2$S(O)Me
CH$_2$SPr–n	CH(Me)S(O)Et	C(Me)$_2$S(O)$_2$Me
CH$_2$S(O)Pr–n	CH(Me)S(O)$_2$Et	C(Me)$_2$SEt
CH$_2$S(O)$_2$Pr–n	CH(Me)SPr–n	C(Me)$_2$S(O)Et
CH$_2$SPr–i	CH(Me)S(O)Pr–n	C(Me)$_2$S(O)$_2$Et
CH$_2$S(O)Pr–i	CH(Me)S(O)$_2$Pr–n	C(Me)$_2$SPr–n

[Tabla 5]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$C(Me)_2S(O)Pr-n$	$(CH_2)_2SPr-n$	$C(Me)_2CH_2S(O)_2Et$
$C(Me)_2S(O)_2Pr-n$	$(CH_2)_2S(O)Pr-n$	$C(Me)_2CH_2SPr-n$
$C(Me)_2SPr-i$	$(CH_2)_2S(O)_2Pr-n$	$C(Me)_2CH_2S(O)Pr-n$
$C(Me)_2S(O)Pr-i$	$(CH_2)_2SPr-i$	$C(Me)_2CH_2S(O)_2Pr-n$
$C(Me)_2S(O)_2Pr-i$	$(CH_2)_2S(O)Pr-i$	$C(Me)_2CH_2SPr-i$
$C(Me)_2SBu-n$	$(CH_2)_2S(O)_2Pr-i$	$C(Me)_2CH_2S(O)Pr-i$
$C(Me)_2S(O)Bu-n$	$(CH_2)_3SMe$	$C(Me)_2CH_2S(O)_2Pr-i$
$C(Me)_2S(O)_2Bu-n$	$(CH_2)_3(O)Me$	$CH(Et)SMe$
$C(Me)_2SBu-i$	$(CH_2)_3S(O)_2Me$	$CH(Et)S(O)Me$
$C(Me)_2S(O)Bu-i$	$(CH_2)_3SEt$	$CH(Et)S(O)_2Me$
$C(Me)_2S(O)_2Bu-i$	$(CH_2)_3S(O)Et$	$CH(Et)SEt$
$C(Me)_2SBu-s$	$(CH_2)_3S(O)_2Et$	$CH(Et)S(O)Et$
$C(Me)_2S(O)Bu-s$	$CH(Me)CH_2SMe$	$CH(Et)S(O)_2Et$
$C(Me)_2S(O)_2Bu-s$	$CH(Me)CH_2S(O)Me$	$CH(Et)SPr-n$
$C(Me)_2SBu-t$	$CH(Me)CH_2S(O)_2Me$	$CH(Et)S(O)Pr-n$
$C(Me)_2S(O)Bu-t$	$CH(Me)CH_2SEt$	$CH(Et)S(O)_2Pr-n$
$C(Me)_2S(O)_2Bu-t$	$CH(Me)CH_2S(O)Et$	$CH(Et)SPr-i$
$C(Me)_2SPen-n$	$CH(Me)CH_2S(O)_2Et$	$CH(Et)S(O)Pr-i$
$C(Me)_2S(O)Pen-n$	$CH(Me)CH_2SPr-n$	$CH(Et)S(O)_2Pr-i$
$C(Me)_2S(O)_2Pen-n$	$CH(Me)CH_2S(O)Pr-n$	$CH(Pr-n)SMe$
$C(Me)_2SPen-i$	$CH(Me)CH_2S(O)_2Pr-n$	$CH(Pr-n)S(O)Me$
$C(Me)_2S(O)Pen-i$	$CH(Me)CH_2SPr-i$	$CH(Pr-n)S(O)_2Me$
$C(Me)_2S(O)_2Pen-i$	$CH(Me)CH_2S(O)Pr-i$	$CH(Pr-n)SEt$
$C(Me)_2SPen-s$	$CH(Me)CH_2S(O)_2Pr-i$	$CH(Pr-n)S(O)Et$
$C(Me)_2S(O)Pen-s$	$CH(Et)CH_2SMe$	$CH(Pr-n)S(O)_2Et$
$C(Me)_2S(O)_2Pen-s$	$CH(Et)CH_2S(O)Me$	$CH(Pr-n)SPr-n$
$C(Me)_2SPen-t$	$CH(Et)CH_2S(O)_2Me$	$CH(Pr-n)S(O)Pr-n$
$C(Me)_2S(O)Pen-t$	$CH(Et)CH_2SEt$	$CH(Pr-n)S(O)_2Pr-n$
$C(Me)_2S(O)_2Pen-t$	$CH(Et)CH_2S(O)Et$	$CH(Pr-n)SPr-i$
$(CH_2)_2SMe$	$CH(Et)CH_2S(O)_2Et$	$CH(Pr-n)S(O)Pr-i$
$(CH_2)_2S(O)Me$	$C(Me)_2CH_2SMe$	$CH(Pr-n)S(O)_2Pr-i$
$(CH_2)_2S(O)_2Me$	$C(Me)_2CH_2S(O)Me$	$CH(Pr-i)SMe$
$(CH_2)_2SEt$	$C(Me)_2CH_2S(O)_2Me$	$CH(Pr-i)S(O)Me$
$(CH_2)_2S(O)Et$	$C(Me)_2CH_2SEt$	$CH(Pr-i)S(O)_2Me$
$(CH_2)_2S(O)_2Et$	$C(Me)_2CH_2S(O)Et$	$CH(Pr-i)SEt$

[Tabla 6]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
CH(Pr-i)S(O)Et	$CH_2SCF(CF_3)_2$	$C(Me)_2S(O)(CH_2)_2CF_3$
CH(Pr-i)$S(O)_2$Et	$CH(Me)SCF_2H$	$C(Me)_2S(O)_2(CH_2)_2CF_3$
CH(Pr-i)SPr-n	$CH(Me)S(O)CF_2H$	$C(Me)_2S(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-i)S(O)Pr-n	$CH(Me)S(O)_2CF_2H$	$C(Me)_2S(O)(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-i)$S(O)_2$Pr-n	$CH(Me)SCF_3$	$C(Me)_2S(O)_2(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-i)SPr-i	$CH(Me)S(O)CF_3$	$C(Me)_2S(CH_2)_2Br$
CH(Pr-i)S(O)Pr-i	$CH(Me)S(O)_2CF_3$	$C(Me)_2S(O)(CH_2)_2Br$
CH(Pr-i)$S(O)_2$Pr-i	$CH(Me)SCH_2CF_2H$	$C(Me)_2S(O)_2(CH_2)_2Br$
CH_2SCF_2H	$CH(Me)S(O)CH_2CF_2H$	$(CH_2)_2SCF_3$
$CH_2S(O)CF_2H$	$CH(Me)S(O)_2CH_2CF_2H$	$(CH_2)_2S(O)CF_3$
$CH_2S(O)_2CF_2H$	$CH(Me)SCH_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)_2CF_3$
CH_2SCF_3	$CH(Me)S(O)CH_2CF_3$	$(CH_2)_2SCH_2CF_2H$
$CH_2S(O)CF_3$	$CH(Me)S(O)_2CH_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)CH_2CF_2H$
$CH_2S(O)_2CF_3$	$CH(Me)S(CH_2)_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)_2CH_2CF_2H$
$CH_2SCH_2CF_2H$	$CH(Me)S(O)(CH_2)_2CF_3$	$(CH_2)_2SCH_2CF_3$
$CH_2S(O)CH_2CF_2H$	$CH(Me)S(O)_2(CH_2)_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)CH_2CF_3$
$CH_2S(O)_2CH_2CF_2H$	$CH(Me)S(CH_2)_2Cl$	$(CH_2)_2S(O)_2CH_2CF_3$
$CH_2SCH_2CF_3$	$CH(Me)S(O)(CH_2)_2Cl$	$(CH_2)_2S(CH_2)_2Cl$
$CH_2S(O)CH_2CF_3$	$CH(Me)S(O)_2(CH_2)_2Cl$	$(CH_2)_2S(O)(CH_2)_2Cl$
$CH_2S(O)_2CH_2CF_3$	$CH(Me)S(CH_2)_2Br$	$(CH_2)_2S(O)_2(CH_2)_2Cl$
$CH_2S(CH_2)_2CF_3$	$CH(Me)S(O)(CH_2)_2Br$	$(CH_2)_2S(CH_2)_2Br$
$CH_2S(O)(CH_2)_2CF_3$	$CH(Me)S(O)_2(CH_2)_2Br$	$(CH_2)_2S(O)(CH_2)_2Br$
$CH_2S(O)_2(CH_2)_2CF_3$	$C(Me)_2SCF_2H$	$(CH_2)_2S(O)_2(CH_2)_2Br$
$CH_2S(CH_2)_2Cl$	$C(Me)_2S(O)CF_2H$	$CH=CH_2$
$CH_2S(O)(CH_2)_2Cl$	$C(Me)_2S(O)_2CF_2H$	CH=CHMe
$CH_2S(O)_2(CH_2)_2Cl$	$C(Me)_2SCF_3$	$CH=CMe_2$
$CH_2S(CH_2)_2Br$	$C(Me)_2S(O)CF_3$	$CH_2CH=CH_2$
$CH_2S(O)(CH_2)_2Br$	$C(Me)_2S(O)_2CF_3$	$CH_2CH=CHMe$
$CH_2S(O)_2(CH_2)_2Br$	$C(Me)_2SCH_2CF_2H$	$CH_2C(Me)=CH_2$
$CH_2SCHFCH_3$	$C(Me)_2S(O)CH_2CF_2H$	$(CH_2)_2CH=CMe_2$
$CH_2SCF_2CH_3$	$C(Me)_2S(O)_2CH_2CF_2H$	$C(Me)=CH_2$
$CH_2SCF(CH_3)_2$	$C(Me)_2SCH_2CF_3$	C(Me)=CHMe
$CH_2SCF_2CF_2H$	$C(Me)_2S(O)CH_2CF_3$	$C(Me)=CMe_2$
$CH_2SCF_2CF_3$	$C(Me)_2S(O)_2CH_2CF_3$	$CH(Me)CH=CH_2$
$CH_2SCF_2CF_2CF_3$	$C(Me)_2S(CH_2)_2CF_3$	$C(Et)=CH_2$

[Tabla 7]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
C(Et)=CHMe	2,4-$(Cl)_2$-Ph	3-F-4-Cl-Ph
C(Et)=CMe_2	2,5-$(Cl)_2$-Ph	3-F-5-Cl-Ph
CH(Et)CH=CH_2	2,6-$(Cl)_2$-Ph	2-Me-3-F-Ph
C≡CH	3,4-$(Cl)_2$-Ph	2-Me-4-F-Ph
C≡CMe	3,5-$(Cl)_2$-Ph	2-Me-5-F-Ph
CH_2C≡CH	2,3-$(Me)_2$-Ph	3-Me-4-F-Ph
CH_2C≡CMe	2,4-$(Me)_2$-Ph	3-Me-5-F-Ph
CH(Me)C≡CH	2,5-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-3-MeO-Ph
CH(Me)C≡CMe	2,6-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-4-MeO-Ph
Ph	3,4-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-5-MeO-Ph
2-F-Ph	3,5-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-6-MeO-Ph
3-F-Ph	2,3-$(MeO)_2$-Ph	3-Cl-4-MeO-Ph
4-F-Ph	2,4-$(MeO)_2$-Ph	3-Cl-5-MeO-Ph
2-Cl-Ph	2,5-$(MeO)_2$-Ph	2-F-3-MeO-Ph
3-Cl-Ph	2,6-$(MeO)_2$-Ph	2-F-4-MeO-Ph
4-Cl-Ph	3,4-$(MeO)_2$-Ph	2-F-5-MeO-Ph
2-Br-Ph	3,5-$(MeO)_2$-Ph	2-F-6-MeO-Ph
3-Br-Ph	2-Cl-3-Me-Ph	3-F-4-MeO-Ph
4-Br-Ph	2-Cl-4-Me-Ph	3-F-5-MeO-Ph
2-Me-Ph	2-Cl-5-Me-Ph	2-MeO-3-F-Ph
3-Me-Ph	3-Cl-4-Me-Ph	2-MeO-4-F-Ph
4-Me-Ph	3-Cl-5-Me-Ph	2-MeO-5-F-Ph
2-CF_3-Ph	2-Cl-3-F-Ph	2-MeO-6-F-Ph
3-CF_3-Ph	2-Cl-4-F-Ph	3-MeO-4-F-Ph
4-CF_3-Ph	2-Cl-5-F-Ph	3-MeO-5-F-Ph
2-MeO-Ph	3-Cl-4-F-Ph	2-MeO-3-Cl-Ph
3-MeO-Ph	3-Cl-5-F-Ph	2-MeO-4-Cl-Ph
4-MeO-Ph	2-F-3-Me-Ph	2-MeO-5-Cl-Ph
2,3-$(F)_2$-Ph	2-F-4-Me-Ph	2-MeO-6-Cl-Ph
2,4-$(F)_2$-Ph	2-F-5-Me-Ph	3-MeO-4-Cl-Ph
2,5-$(F)_2$-Ph	3-F-4-Me-Ph	3-MeO-5-Cl-Ph
2,6-$(F)_2$-Ph	3-F-5-Me-Ph	2-Me-3-MeO-Ph
3,4-$(F)_2$-Ph	2-F-3-Cl-Ph	2-Me-4-MeO-Ph
3,5-$(F)_2$-Ph	2-F-4-Cl-Ph	2-Me-5-MeO-Ph
2,3-$(Cl)_2$-Ph	2-F-5-Cl-Ph	2-Me-6-MeO-Ph

[Tabla 8]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
3-Me-4-MeO-Ph	D-11	CH_2(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
3-Me-5-MeO-Ph	D-12	CH_2(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-3-Me-Ph	D-13a	CH_2(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-4-Me-Ph	D-14	CH_2(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-5-Me-Ph	D-16	CH(Me)(2-MeO-Ph)
2-MeO-6-Me-Ph	D-16a	CH(Me)(3-MeO-Ph)
3-MeO-4-Me-Ph	D-16b	CH(Me)(4-MeO-Ph)
3-MeO-5-Me-Ph	D-16c	CH(Me)(2,3-$(MeO)_2$-Ph)
3,5-$(F)_2$-4-Me-Ph	D-16d	CH(Me)(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
3,5-$(F)_2$-4-MeO-Ph	D-16e	CH(Me)(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
3,4,5-$(MeO)_3$-Ph	D-16f	CH(Me)(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
D-3	D-16g	CH(Me)(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
D-3a	D-16h	CH(Me)(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
D-4	D-16i	CH(Et)(2-MeO-Ph)
D-4a	D-16j	CH(Et)(3-MeO-Ph)
D-4b	D-16k	CH(Et)(4-MeO-Ph)
D-8	D-16m	$(CH_2)_2$(2-MeO-Ph)
D-8a	D-16n	$(CH_2)_2$(3-MeO-Ph)
D-8b	D-16p	$(CH_2)_2$(4-MeO-Ph)
D-8c	D-17	CHO
D-8d	D-17a	CH=NOMe
D-8e	D-17b	OMe
D-8f	D-19	OEt
D-8g	D-24a	OPr-n
D-8h	D-24b	OPr-i
D-9	D-24c	OBu-n
D-9a	D-24d	OBu-i
D-9c	D-24e	OBu-s
D-9d	D-24f	OBu-t
D-9f	CH_2Ph	OPen-n
D-9g	CH_2(2-MeO-Ph)	OPen-i
D-9i	CH_2(3-MeO-Ph)	OPen-s
D-9j	CH_2(4-MeO-Ph)	OPen-t
D-9m	CH_2(2,3-$(MeO)_2$-Ph)	OHex-n
D-10a	CH_2(2,4-$(MeO)_2$-Ph)	SMe

[Tabla 9]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
S(O)Me	SPen-n	$S(CH_2)_2Cl$
$S(O)_2Me$	S(O)Pen-n	$S(O)(CH_2)_2Cl$
SEt	$S(O)_2Pen-n$	$S(O)_2(CH_2)_2Cl$
S(O)Et	SPen-i	$SCH(Me)CH_2Cl$
$S(O)_2Et$	S(O)Pen-i	$SCH_2CH(Me)Cl$
SPr-n	$S(O)_2Pen-i$	$S(CH_2)_3Cl$
S(O)Pr-n	SPen-c	SCF_3
$S(O)_2Pr-n$	S(O)Pen-c	SCH_2CF_3
SPr-i	$S(O)_2Pen-c$	$S(O)CH_2CF_3$
S(O)Pr-i	SPen-s	$S(O)_2CH_2CF_3$
$S(O)_2Pr-i$	S(O)Pen-s	$SCH(Me)CF_3$
SPr-c	$S(O)_2Pen-s$	$S(CH_2)_2CF_3$
S(O)Pr-c	SPen-t	$S(CH_2)_3CF_3$
$S(O)_2Pr-c$	S(O)Pen-t	$SCHFCH_3$
S(D-16)	$S(O)_2Pen-t$	SCF_2CH_3
S(O)(D-16)	SHex-n	$SCF(CH_3)_2$
$S(O)_2$(D-16)	SHex-c	SCF_2CF_2H
S(D-16e)	$SCH_2CH=CH_2$	SCF_2CF_3
S(O)(D-16e)	$S(O)CH_2CH=CH_2$	$SCF_2CF_2CF_3$
$S(O)_2$(D-16e)	$S(O)_2CH_2CH=CH_2$	$SCF(CF_3)$
SBu-n	$SCH(Me)CH=CH_2$	SCH_2OMe
S(O)Bu-n	$SC(Me)_2CH=CH_2$	$S(CH_2)_2OMe$
$S(O)_2Bu-n$	$SCH_2CH=CHMe$	$S(O)(CH_2)_2OMe$
SBu-i	$SCH_2C(Me)=CH_2$	$S(O)_2(CH_2)_2OMe$
S(O)Bu-i	$S(CH_2)_2CH=CMe_2$	$SCH(Me)CH_2OMe$
$S(O)_2Bu-i$	$SC(Me)=CH_2$	$S(O)CH(Me)CH_2OMe$
SBu-c	SC(Me)=CH(Me)	$S(O)_2CH(Me)CH_2OMe$
S(O)Bu-c	$SCH_2C\equiv CH$	$SCH_2CH(Me)OMe$
$S(O)_2Bu-c$	$S(O)CH_2C\equiv CH$	$S(O)CH_2CH(Me)OMe$
SBu-s	$S(O)_2CH_2C\equiv CH$	$S(O)_2CH_2CH(Me)OMe$
S(O)Bu-s	$SCH(Me)C\equiv CH$	$SC(Me)_2CH_2OMe$
$S(O)_2Bu-s$	$SC(Me)_2C\equiv CH$	$S(CH_2)_3OMe$
SBu-t	$SCH_2C\equiv CMe$	SCH_2OEt
S(O)Bu-t	SCH_2Cl	$S(CH_2)_2OEt$
$S(O)_2Bu-t$	SCH(Me)Cl	$S(O)(CH_2)_2OEt$

[Tabla 10]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$S(O)_2(CH_2)_2OEt$	$S(O)_2CH_2CN$	SCH(Me)C(O)Me
$SCH(Me)CH_2OEt$	SCH(Me)CN	$S(CH_2)_2C(O)Me$
$SCH_2OPr\text{-}i$	S(O)CH(Me)CN	$SCH_2C(O)OMe$
$S(CH_2)_2OPr\text{-}i$	$S(O)_2CH(Me)CN$	SCH(Me)C(O)OMe
$S(O)(CH_2)_2OPr\text{-}i$	$SC(Me)_2CN$	$S(CH_2)_2C(O)OMe$
$S(O)_2(CH_2)_2OPr\text{-}i$	$S(O)C(Me)_2CN$	$SCH_2C(O)OEt$
$SCH(Me)CH_2OPr\text{-}i$	$S(O)_2C(Me)_2CN$	SCH(Me)C(O)OEt
$SCH_2Pr\text{-}c$	$S(CH_2)_2CN$	$S(CH_2)_2C(O)OEt$
$S(O)CH_2Pr\text{-}c$	$S(O)(CH_2)_2CN$	SCH_2(D-8a)
$S(O)_2CH_2Pr\text{-}c$	$S(O)_2(CH_2)_2CN$	$S(O)CH_2$(D-8a)
SCH(Me)Pr-c	SCH_2Ph	$S(O)_2CH_2$(D-8a)
S(O)CH(Me)Pr-c	$S(O)CH_2Ph$	SCH_2(D-8b)
$S(O)_2CH(Me)Pr\text{-}c$	$S(O)_2CH_2Ph$	$S(O)CH_2$(D-8b)
$S(CH_2)_2Pr\text{-}c$	SCH(Me)Ph	$S(O)_2CH_2$(D-8b)
SCH_2(D-16)	S(O)CH(Me)Ph	SCH_2(D-8c)
$S(O)CH_2$(D-16)	$S(O)_2CH(Me)Ph$	$S(O)CH_2$(D-8c)
$S(O)_2CH_2$(D-16)	SCH_2(2-MeO-Ph)	$S(O)_2CH_2$(D-8c)
SCH_2(D-16e)	$S(O)CH_2$(2-MeO-Ph)	SCH_2(D-8d)
$S(O)CH_2$(D-16e)	$S(O)_2CH_2$(2-MeO-Ph)	$S(O)CH_2$(D-8d)
$S(O)_2CH_2$(D-16e)	SCH(Me)(2-MeO-Ph)	$S(O)_2CH_2$(D-8d)
$SCH_2Bu\text{-}c$	S(O)CH(Me)(2-MeO-Ph)	SCH_2(D-8e)
$S(O)CH_2Bu\text{-}c$	$S(O)_2CH(Me)(2\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$S(O)_2CH_2$(D-8e)
$S(O)_2CH_2Bu\text{-}c$	$SCH_2(3\text{-}MeO\text{-}Ph)$	SCH_2(D-8f)
SCH(Me)Bu-c	$S(O)CH_2(3\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$S(O)_2CH_2$(D-8f)
$S(CH_2)_2Bu\text{-}c$	$S(O)_2CH_2(3\text{-}MeO\text{-}Ph)$	SCH_2(D-8g)
$SCH_2Pen\text{-}c$	SCH(Me)(3-MeO-Ph)	$S(O)_2CH_2$(D-8g)
$S(O)CH_2Pen\text{-}c$	S(O)CH(Me)(3-MeO-Ph)	SCH_2(D-8h)
$S(O)_2CH_2Pen\text{-}c$	$S(O)_2CH(Me)(3\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$S(O)_2CH_2$(D-8h)
SCH(Me)Pen-c	$SCH_2(4\text{-}MeO\text{-}Ph)$	SCH_2(D-15)
$S(CH_2)_2Pen\text{-}c$	$S(O)CH_2(4\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$S(O)CH_2$(D-15)
$SCH_2Hex\text{-}c$	$S(O)_2CH_2(4\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$S(O)_2CH_2$(D-15)
SCH(Me)Hex-c	SCH(Me)(4-MeO-Ph)	SCH(Me)(D-15)
$S(CH_2)_2Hex\text{-}c$	S(O)CH(Me)(4-MeO-Ph)	S(O)CH(Me)(D-15)
SCH_2CN	$S(O)_2CH(Me)(4\text{-}MeO\text{-}Ph)$	$S(O)_2CH(Me)$(D-15)
$S(O)CH_2CN$	$SCH_2C(O)Me$	$S(CH_2)_2$(D-15)

[Tabla 11]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$S(O)(CH_2)_2$(D-15)	N(Me)Pr-c	N(Pr-i)Pr-i
$S(O)_2(CH_2)_2$(D-15)	N(Me)(D-16)	N(Pr-i)Pr-c
SCH_2(D-18)	N(Me)(D-16e)	N(Pr-i)(D-16)
$S(O)CH_2$(D-18)	N(Me)Bu-n	N(Pr-i)(D-16e)
$S(O)_2CH_2$(D-18)	N(Me)Bu-i	N(Pr-i)Bu-n
SCH(Me)(D-18)	N(Me)Bu-c	N(Pr-i)Bu-i
S(O)CH(Me)(D-18)	N(Me)Bu-s	N(Pr-i)Bu-c
$S(O)_2$CH(Me)(D-18)	N(Me)Bu-t	N(Pr-i)Bu-s
$S(CH_2)_2$(D-18)	N(Me)Pen-n	$NHCH_2OMe$
$S(O)(CH_2)_2$(D-18)	N(Me)Pen-i	$NHCH_2OEt$
$S(O)_2(CH_2)_2$(D-18)	N(Me)Pen-c	NHCH(Me)OMe
NHMe	N(Me)Pen-s	NHCH(Me)OEt
NHEt	N(Me)Pen-t	$NHC(Me)_2OMe$
NHPr-n	N(Me)(3-Pen)	$NHC(Me)_2OEt$
NHPr-i	N(Me)Hex-n	$NH(CH_2)_2OMe$
NHPr-c	N(Me)Hex-c	$NH(CH_2)_2OEt$
NH(D-16)	N(Et)Et	$NH(CH_2)_2OPr$-n
NH(D-16e)	N(Et)Pr-n	$NH(CH_2)_2OPr$-i
NHBu-n	N(Et)Pr-i	$N(Me)CH_2OMe$
NHBu-i	N(Et)Pr-c	$N(Me)CH_2OEt$
NHBu-c	N(Et)(D-16)	N(Me)CH(Me)OMe
NHBu-s	N(Et)(D-16e)	N(Me)CH(Me)OEt
NHBu-t	N(Et)Bu-n	$N(Me)C(Me)_2OMe$
NHPen-n	N(Et)Bu-i	$N(Me)C(Me)_2OEt$
NHPen-i	N(Et)Bu-c	$N(Me)(CH_2)_2OMe$
NHPen-c	N(Et)Bu-s	$N(Me)(CH_2)_2OEt$
NHPen-s	N(Pr-n)Pr-n	$N(Me)(CH_2)_2OPr$-n
NHPen-t	N(Pr-n)Pr-i	$N(Me)(CH_2)_2OPr$-i
NH(3-Pen)	N(Pr-n)Pr-c	$N(Et)C(Me)_2OMe$
NHHex-n	N(Pr-n)(D-16)	$N(Et)C(Me)_2OEt$
NHHex-c	N(Pr-n)(D-16e)	$N(Et)(CH_2)_2OMe$
N(Me)Me	N(Pr-n)Bu-n	$N(Et)(CH_2)_2OEt$
N(Me)Et	N(Pr-n)Bu-i	$N(Et)(CH_2)_2OPr$-n
N(Me)Pr-n	N(Pr-n)Bu-c	$N(Et)(CH_2)_2OPr$-i
N(Me)Pr-i	N(Pr-n)Bu-s	$N(Pr-n)(CH_2)_2OMe$

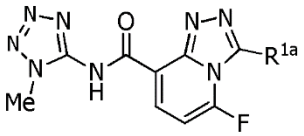
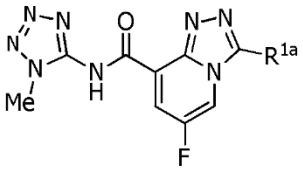
[Tabla 12]

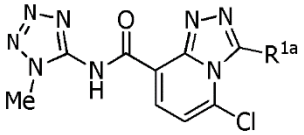
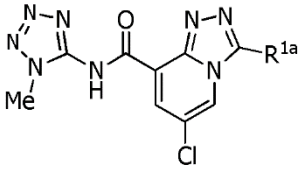
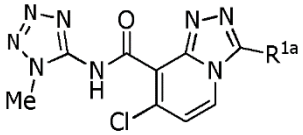
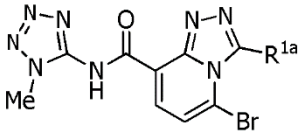
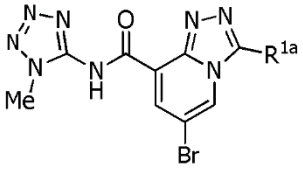
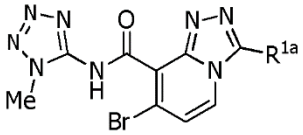
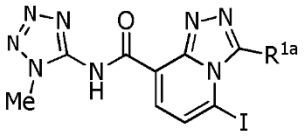
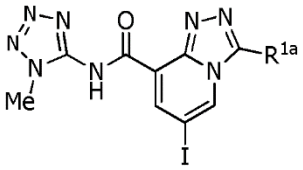
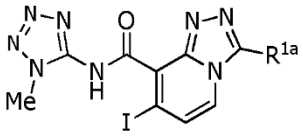
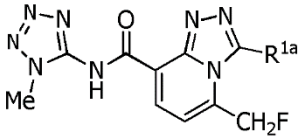
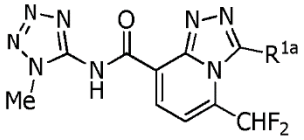
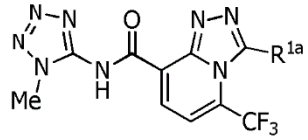
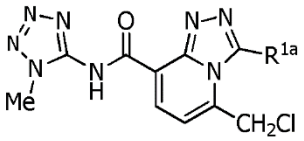
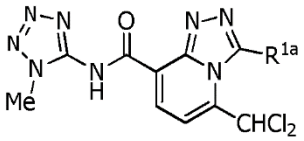
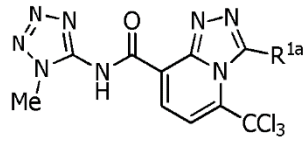
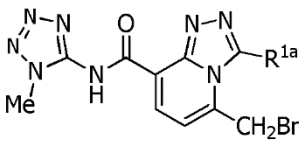
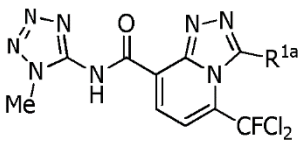
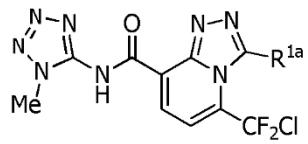
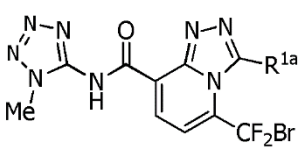
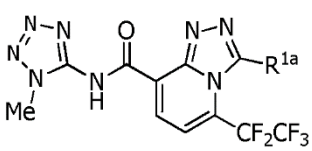
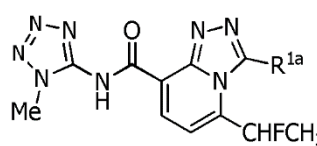
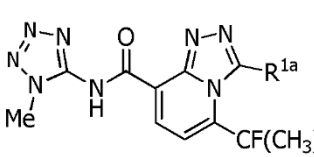
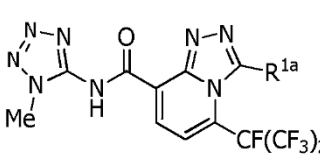
R^{1a}
N(Pr-n)$(CH_2)_2$OEt
N(Pr-n)$(CH_2)_2$OPr-n
N(Pr-n)$(CH_2)_2$OPr-i
N(Pr-i)$(CH_2)_2$OMe
N(Pr-i)$(CH_2)_2$OEt
N(Pr-i)$(CH_2)_2$OPr-n
N(Pr-i)$(CH_2)_2$OPr-i
$NHCH_2SMe$
$NHCH_2SEt$
NHCH(Me)SMe
NHCH(Me)SEt
$NHC(Me)_2SMe$
$NHC(Me)_2SEt$
$NH(CH_2)_2SMe$
$NH(CH_2)_2S(O)Me$
$NH(CH_2)_2S(O)_2Me$
$NH(CH_2)_2SEt$
$NH(CH_2)_2S(O)Et$
$NH(CH_2)_2S(O)_2Et$
$NH(CH_2)_2SPr$-i
$NH(CH_2)_2S(O)Pr$-i
$NH(CH_2)_2S(O)_2Pr$-i
$N(Me)CH_2SMe$
$N(Me)CH_2SEt$
N(Me)CH(Me)SMe
N(Me)CH(Me)SEt
$N(Me)C(Me)_2SMe$
$N(Me)C(Me)_2SEt$
$N(Me)(CH_2)_2SMe$
$N(Me)(CH_2)_2S(O)Me$
$N(Me)(CH_2)_2S(O)_2Me$
$N(Me)(CH_2)_2SEt$
$N(Me)(CH_2)_2S(O)Et$
$N(Me)(CH_2)_2S(O)_2Et$
$N(Me)(CH_2)_2SPr$-i

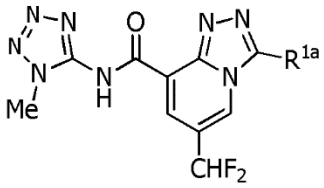
R^{1a}
$N(Me)(CH_2)_2S(O)Pr$-i
$N(Me)(CH_2)_2S(O)_2Pr$-i
$NHCF_2H$
$NHCF_3$
$NHCH_2CF_2H$
$NHCH_2CF_3$
$NH(CH_2)_2CF_3$
$NH(CH_2)_2Cl$
$NH(CH_2)_3Cl$
$N(Me)CF_2H$
$N(Me)CF_3$
$N(Me)CH_2CF_2H$
$N(Me)CH_2CF_3$
$N(Me)(CH_2)_2CF_3$
$N(Me)(CH_2)_2Cl$
$N(Me)(CH_2)_3Cl$
$NHCH_2CH{=}CH_2$
$N(Me)CH_2CH{=}CH_2$
$NHCH_2C{\equiv}CH$
$NHCH_2C{\equiv}CMe$
$N(Me)CH_2C{\equiv}CH$
$N(Me)CH_2C{\equiv}CMe$
$NHCH_2CN$
$NH(CH_2)_2CN$
$NH(CH_2)_3CN$
$N(Me)CH_2CN$
$N(Me)(CH_2)_2CN$
$N(Me)(CH_2)_3CN$
NHPh
NH(2-MeO-Ph)
NH(3-MeO-Ph)
NH(4-MeO-Ph)
NH(2,3-$(MeO)_2$-Ph)
NH(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
NH(2,5-$(MeO)_2$-Ph)

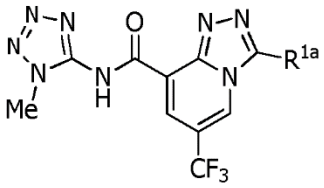
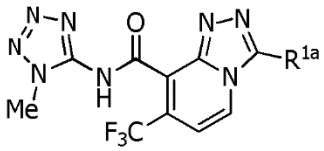
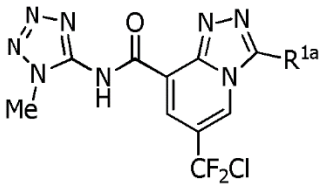
R^{1a}
NH(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
NH(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
NH(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)Ph
N(Me)(2-MeO-Ph)
N(Me)(3-MeO-Ph)
N(Me)(4-MeO-Ph)
N(Me)(2,3-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
$NHCH_2Ph$
$NHCH_2$(2-MeO-Ph)
$NHCH_2$(3-MeO-Ph)
$NHCH_2$(4-MeO-Ph)
$N(Me)CH_2Ph$
$N(Me)CH_2$(2-MeO-Ph)
$N(Me)CH_2$(3-MeO-Ph)
$N(Me)CH_2$(4-MeO-Ph)
NH(D-9b)
NH(D-9e)
NH(D-9h)
NH(D-9k)
N(Me)(D-9b)
N(Me)(D-9e)
N(Me)(D-9h)
N(Me)(D-9k)
$NHSO_2Ph$
$N(Me)SO_2Ph$

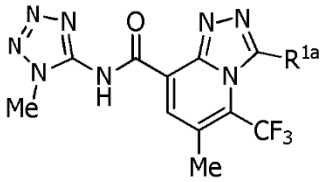
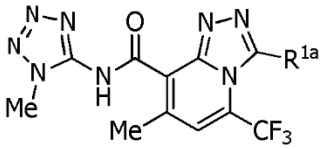
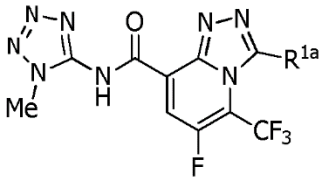
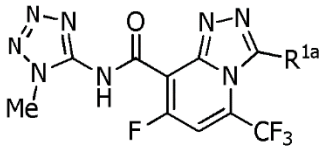
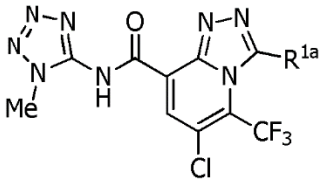
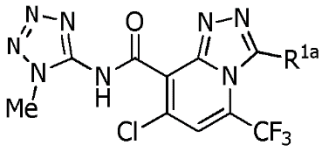
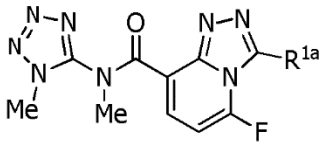
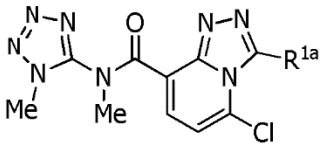
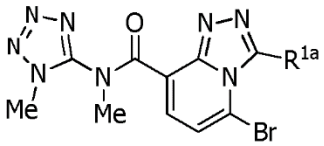
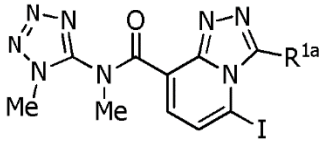
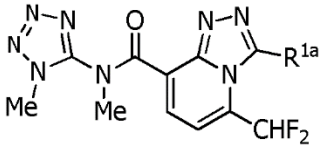
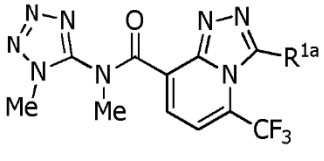
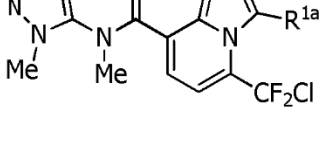
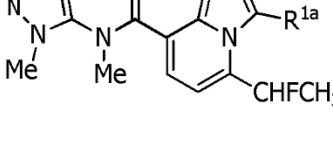
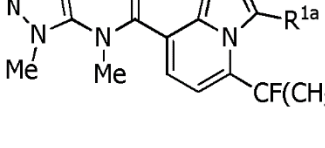
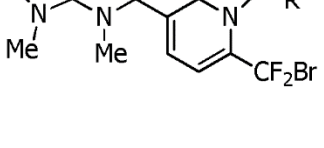
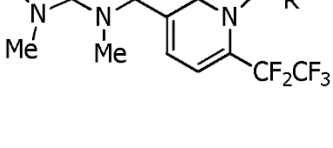
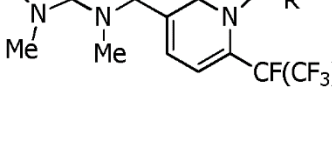
[0190] [Segunda Tabla]

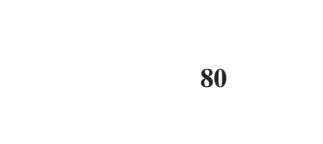



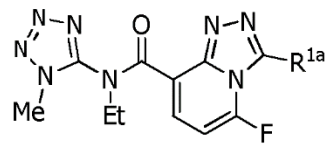
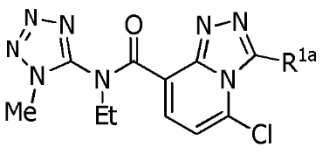
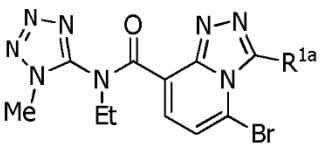
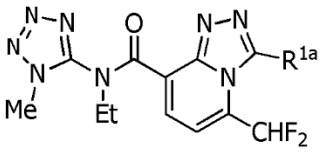
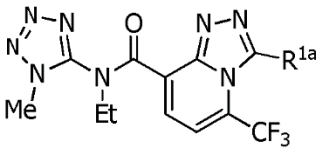
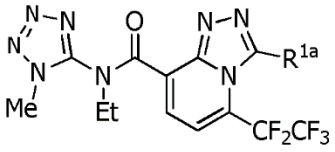
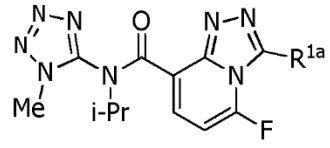
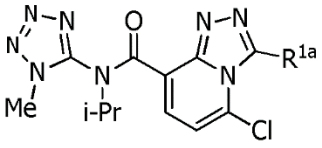
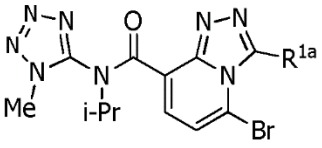
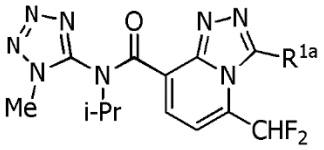
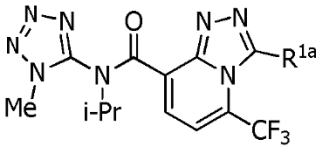
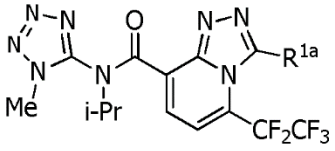
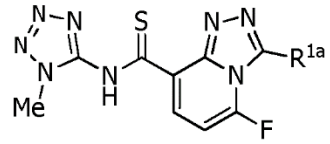
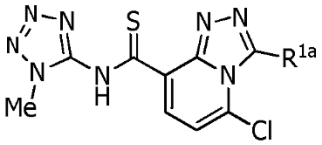
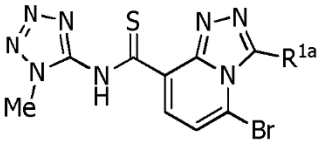
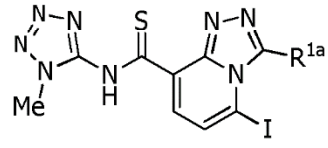
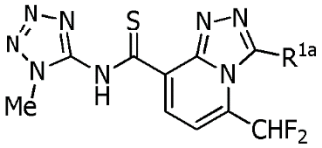
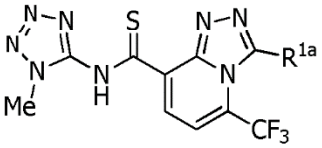
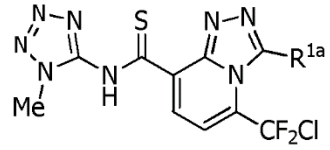
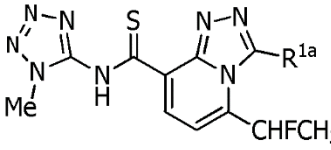
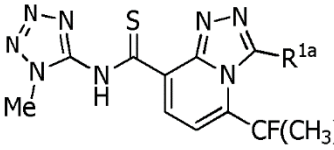
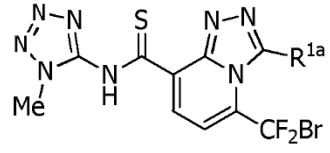
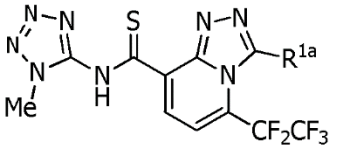
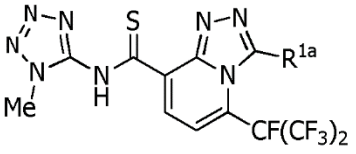
























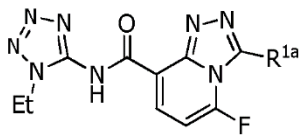
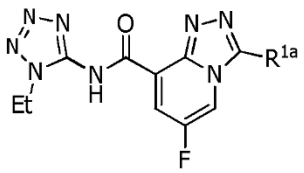
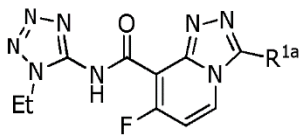
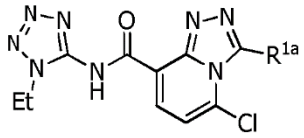
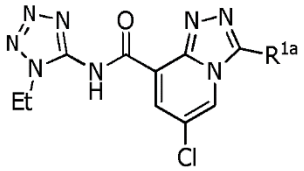
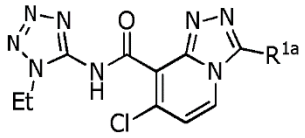
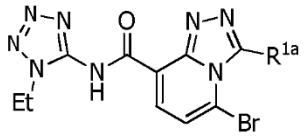
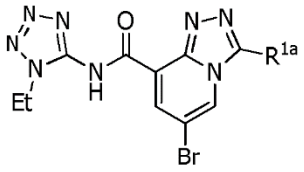
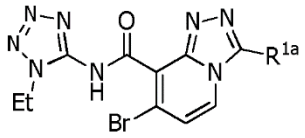
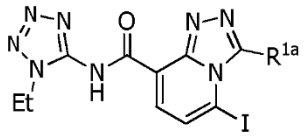
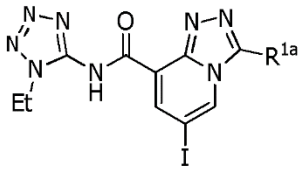
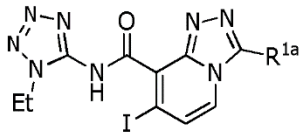
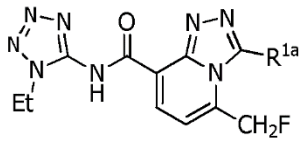
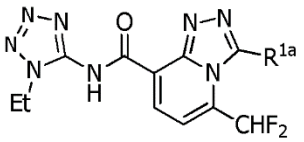
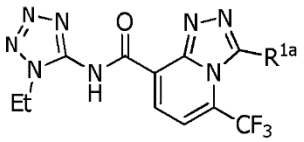
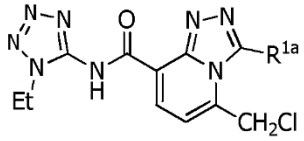
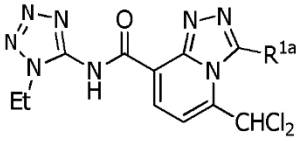
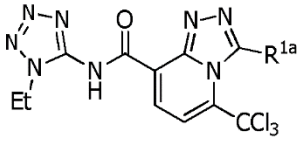
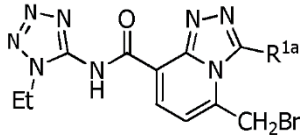
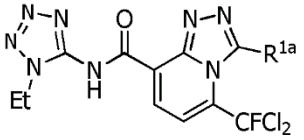
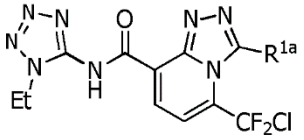
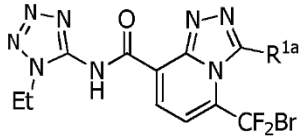
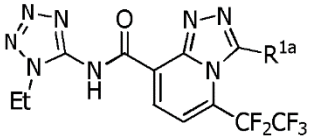
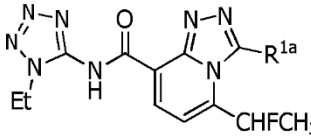
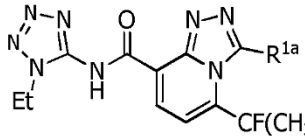
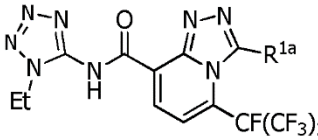


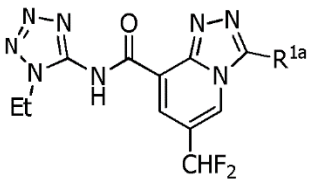
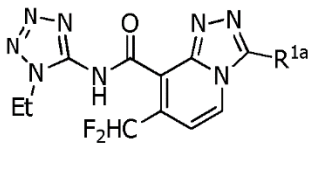
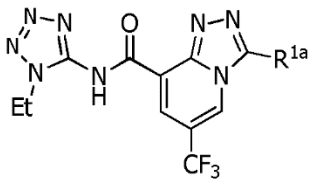
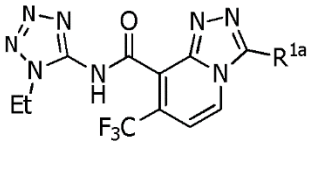
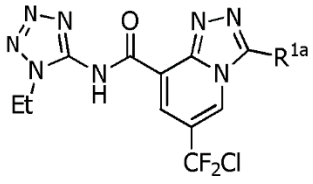
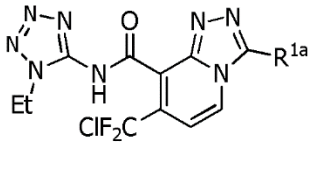
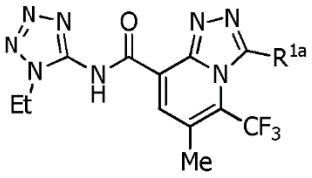
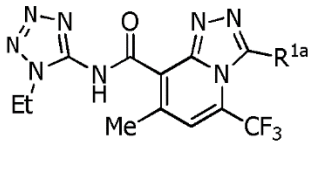
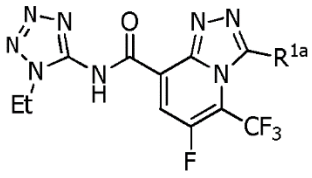
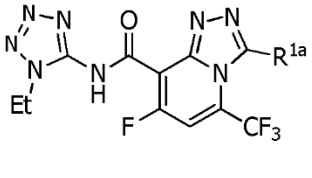
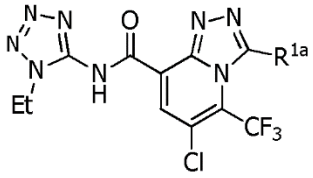
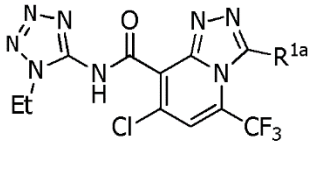
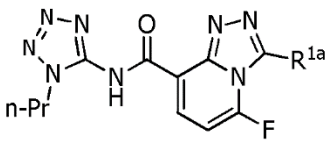
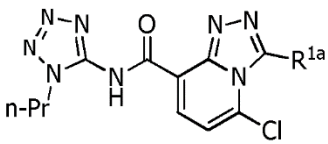
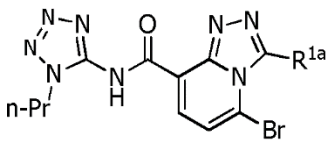
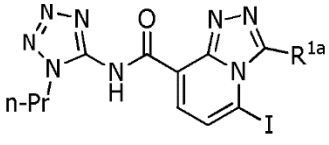
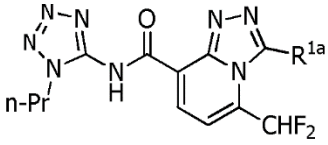
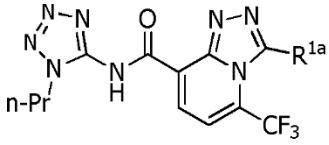
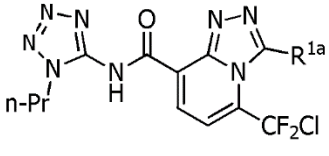
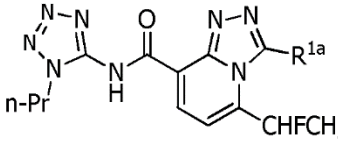
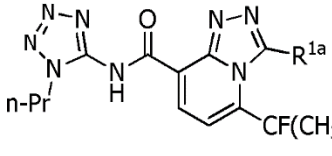
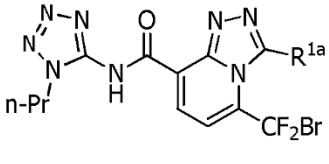
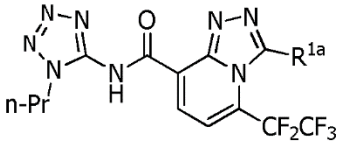
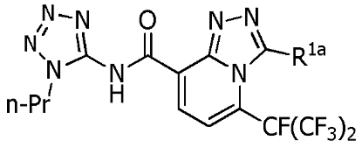




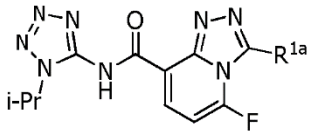
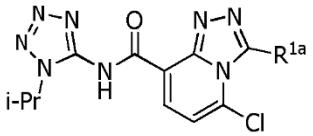
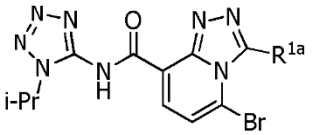
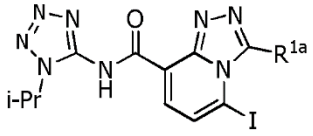
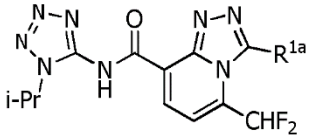
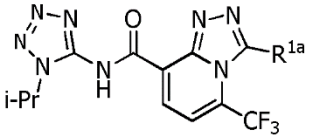
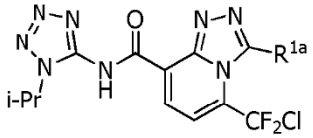
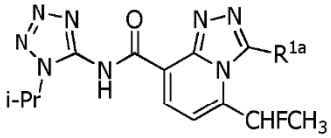
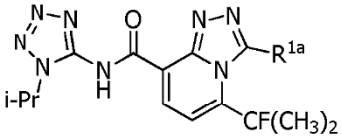
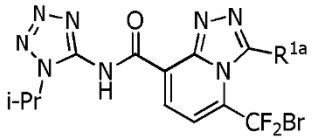
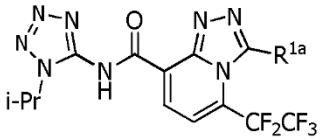
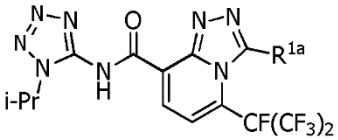
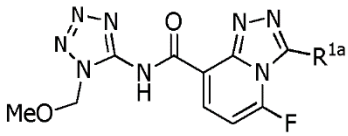
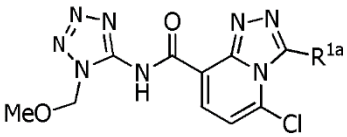
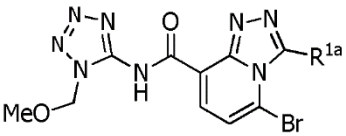
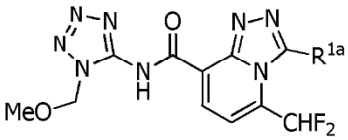
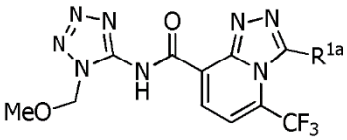
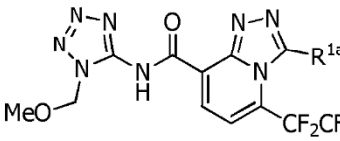
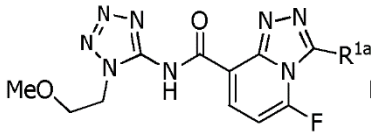
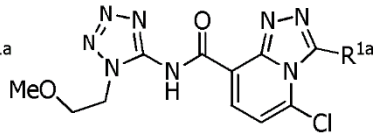
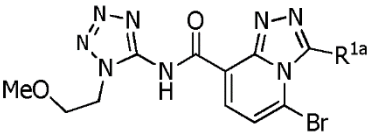
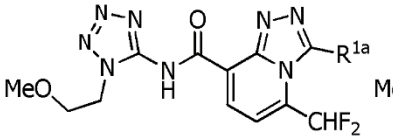
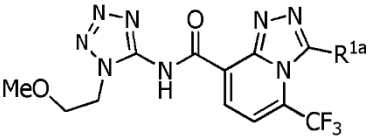
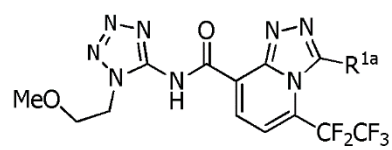



















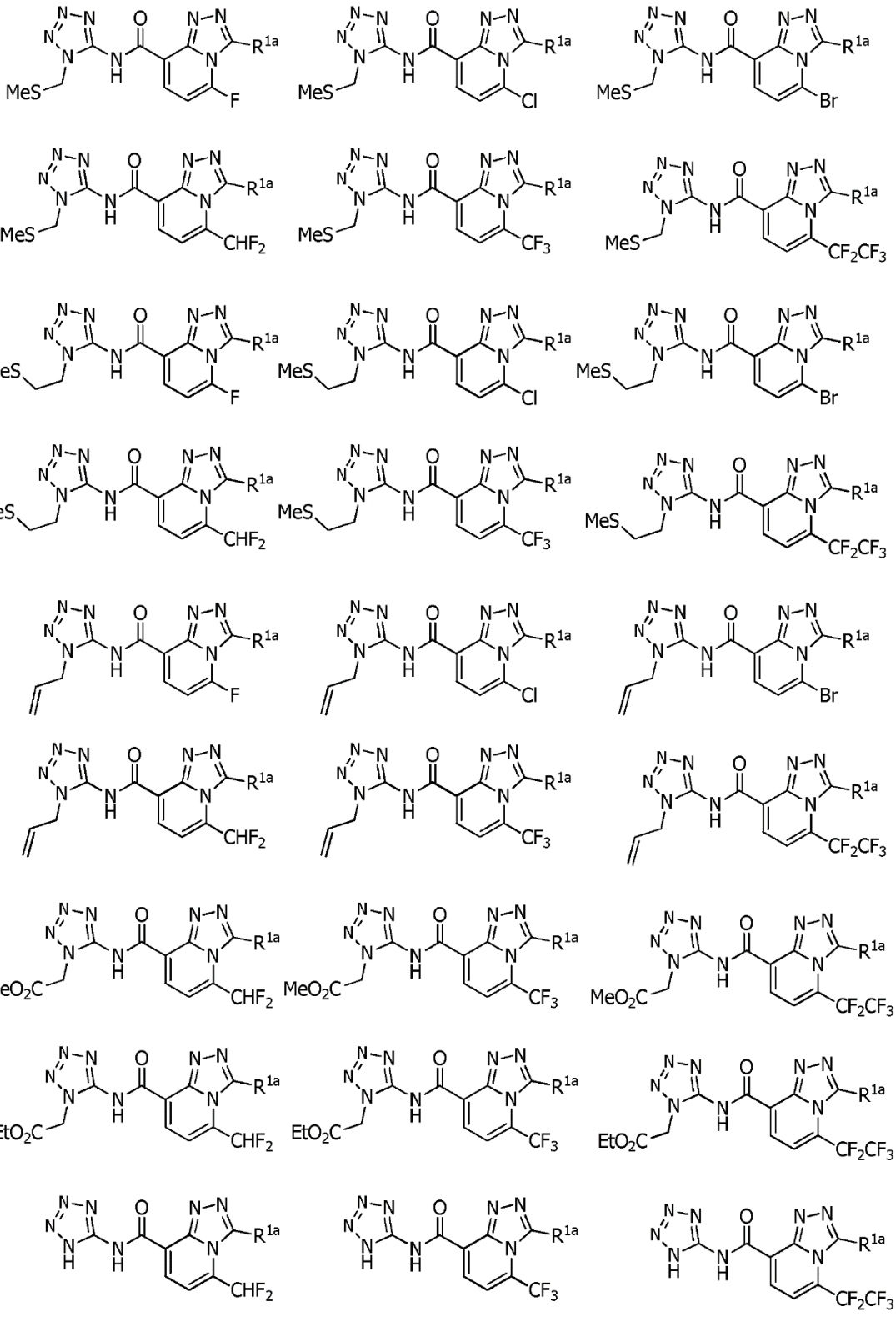


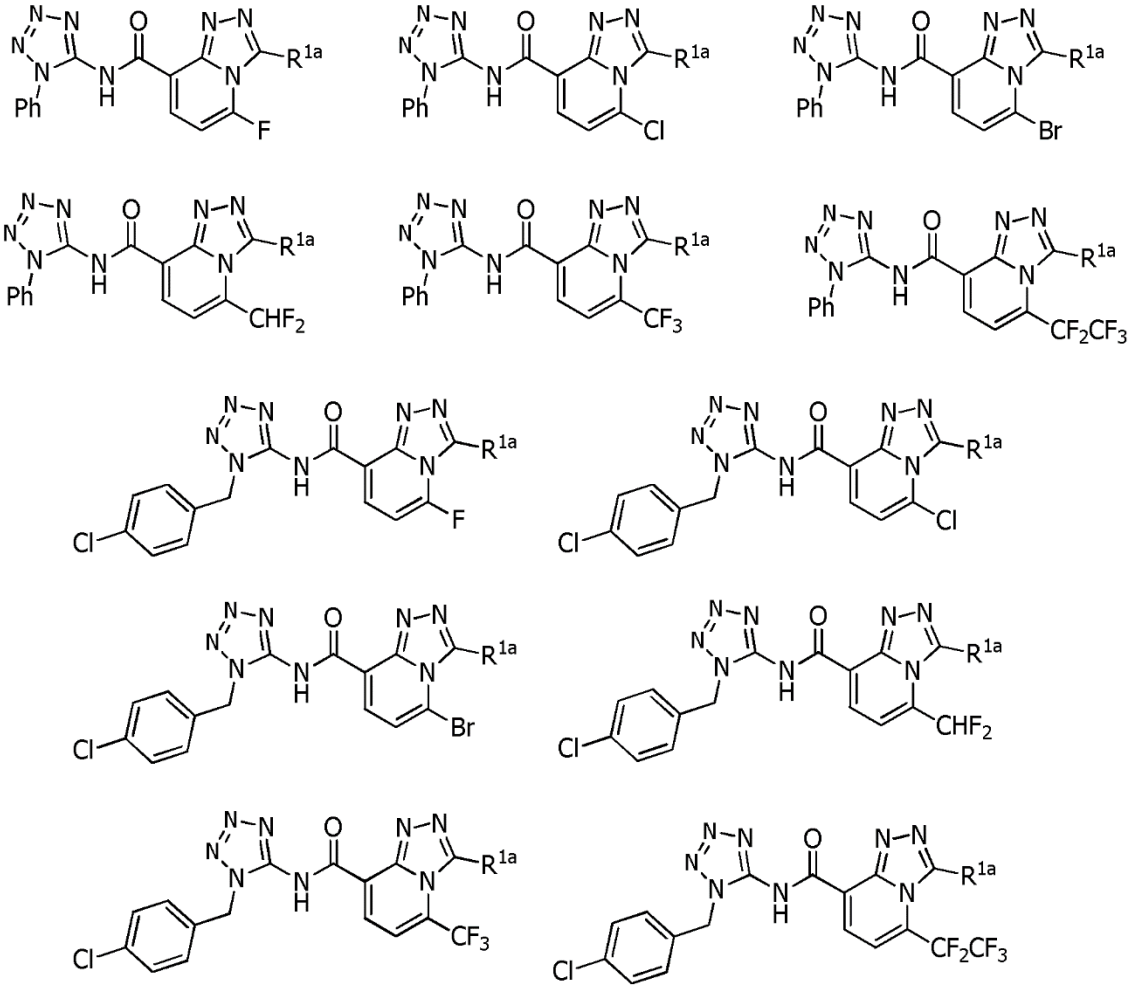





























[Tabla 13]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
H	CH_2OHex-n	$C(Me)_2OMe$
F	CH(Me)OMe	$C(Me)_2OEt$
Cl	CH(Me)OEt	$C(Me)_2OPr$-n
Br	CH(Me)OPr-n	$C(Me)_2OPr$-i
I	CH(Me)OPr-i	$C(Me)_2OBu$-n
Me	CH(Me)OBu-n	$C(Me)_2OBu$-i
Et	CH(Me)OBu-i	$C(Me)_2OBu$-s
Pr-n	CH(Me)OBu-s	$C(Me)_2OBu$-t
Pr-i	CH(Me)OBu-t	$(CH_2)_2OMe$
Pr-c	CH(Me)OPen-n	$(CH_2)_2OEt$
Bu-n	CH(Me)OPen-i	$(CH_2)_2OPr$-n
Bu-i	CH(Me)OPen-s	$(CH_2)_2OPr$-i
Bu-c	CH(Me)OPen-t	$(CH_2)_2OBu$-n
Bu-s	CH(Me)OHex-n	$(CH_2)_2OBu$-i
Bu-t	CH(Et)OMe	$(CH_2)_2OBu$-s
Pen-n	CH(Et)OEt	$(CH_2)_2OBu$-t
Pen-i	CH(Et)OPr-n	$CH(Me)CH_2OMe$
Pen-c	CH(Et)OPr-i	$CH(Me)CH_2OEt$
Pen-s	CH(Et)OBu-n	$CH(Me)CH_2OPr$-n
Pen-t	CH(Et)OBu-i	$CH(Me)CH_2OPr$-i
3-Pen	CH(Et)OBu-s	$CH(Me)CH_2OBu$-n
Hex-n	CH(Et)OBu-t	$CH(Me)CH_2OBu$-i
Hex-c	CH(Et)OPen-n	$CH(Me)CH_2OBu$-s
CH_2OMe	CH(Et)OPen-i	$CH(Me)CH_2OBu$-t
CH_2OEt	CH(Et)OPen-s	$CH(Et)CH_2OMe$
CH_2OPr-n	CH(Et)OPen-t	$CH(Et)CH_2OEt$
CH_2OPr-i	CH(Et)OHex-n	$(CH_2)_3OMe$
CH_2OBu-n	CH(Pr-n)OMe	$(CH_2)_3OEt$
CH_2OBu-i	CH(Pr-n)OEt	$(CH_2)_3OPr$-n
CH_2OBu-s	CH(Pr-n)OPr-n	$(CH_2)_3OPr$-i
CH_2OBu-t	CH(Pr-n)OPr-i	$(CH_2)_3OBu$-n
CH_2OPen-n	CH(Pr-i)OMe	$(CH_2)_3OBu$-i
CH_2OPen-i	CH(Pr-i)OEt	$(CH_2)_3OBu$-s
CH_2OPen-s	CH(Pr-i)OPr-n	$(CH_2)_3OBu$-t
CH_2OPen-t	CH(Pr-i)OPr-i	CH_2OCF_2H

[Tabla 14]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
CH_2OCF_3	CH(iPr)OH	$C(Me)_2OCH_2OPr$–n
$CH_2OCH_2CF_2H$	$C(Me)_2OH$	$C(Me)_2OCH_2OPr$–i
$CH_2OCH_2CF_3$	$(CH_2)_2OH$	$C(Me)_2O(CH_2)_2OMe$
$CH_2O(CH_2)_2CF_3$	$CH(Me)CH_2OH$	$C(Me)_2O(CH_2)_2OEt$
$CH_2O(CH_2)_2Cl$	$(CH_2)_3OH$	$C(Me)_2O(CH_2)_2OPr$–n
$CH_2O(CH_2)_2Br$	CH_2OCH_2OMe	$C(Me)_2O(CH_2)_2OPr$–i
$CH(Me)OCF_2H$	CH_2OCH_2OEt	$(CH_2)_2OCH_2OMe$
$CH(Me)OCF_3$	CH_2OCH_2OPr–n	$(CH_2)_2OCH_2OEt$
$CH(Me)OCH_2CF_2H$	CH_2OCH_2OPr–i	$(CH_2)_2OCH_2OPr$–n
$CH(Me)OCH_2CF_3$	$CH_2O(CH_2)_2OMe$	$(CH_2)_2OCH_2OPr$–i
$CH(Me)O(CH_2)_2CF_3$	$CH_2O(CH_2)_2OEt$	$(CH_2)_2O(CH_2)_2OMe$
$CH(Me)O(CH_2)_2Cl$	$CH_2O(CH_2)_2OPr$–n	$(CH_2)_2O(CH_2)_2OEt$
$CH(Me)O(CH_2)_2Br$	$CH_2O(CH_2)_2OPr$–i	$(CH_2)_2O(CH_2)_2OPr$–n
$CH(Et)OCF_2H$	$CH_2OCH(Me)CH_2OMe$	$(CH_2)_2O(CH_2)_2OPr$–i
$CH(Et)OCF_3$	$CH_2OCH(Me)CH_2OEt$	$CH(Me)CH_2OCH_2OMe$
$CH(Et)OCH_2CF_2H$	$CH_2OCH_2CH(Me)OMe$	$CH(Me)CH_2OCH_2OEt$
$CH(Et)OCH_2CF_3$	$CH_2OCH_2CH(Me)OEt$	$CH(Me)CH_2O(CH_2)_2OMe$
$CH(Et)O(CH_2)_2CF_3$	$CH_2OCH(Me)OMe$	$CH(Me)CH_2O(CH_2)_2OEt$
$CH(Et)O(CH_2)_2Cl$	$CH_2OCH(Me)OEt$	$CH(Et)CH_2OCH_2OMe$
$CH(Et)O(CH_2)_2Br$	$CH_2O(CH_2)_3OMe$	$CH(Et)CH_2OCH_2OEt$
$C(Me)_2OCF_2H$	$CH_2O(CH_2)_3OEt$	$CH(Et)CH_2O(CH_2)_2OMe$
$C(Me)_2OCF_3$	$CH(Me)OCH_2OMe$	$CH(Et)CH_2O(CH_2)_2OEt$
$C(Me)_2OCH_2CF_2H$	$CH(Me)OCH_2OEt$	$CH(Et)O(CH_2)_2OMe$
$C(Me)_2OCH_2CF_3$	$CH(Me)OCH_2OPr$–n	$CH(Et)O(CH_2)_2OEt$
$C(Me)_2O(CH_2)_2CF_3$	$CH(Me)OCH_2OPr$–i	$CH(Et)O(CH_2)_2OPr$–n
$C(Me)_2O(CH_2)_2Cl$	$CH(Me)O(CH_2)_2OMe$	$CH(Et)O(CH_2)_2OPr$–i
$C(Me)_2O(CH_2)_2Br$	$CH(Me)O(CH_2)_2OEt$	CH(Pr–n)$O(CH_2)_2OMe$
$(CH_2)_2OCF_3$	$CH(Me)O(CH_2)_2OPr$–n	CH(Pr–n)$O(CH_2)_2OEt$
$(CH_2)_2OCH_2CF_2H$	$CH(Me)O(CH_2)_2OPr$–i	CH(Pr–n)$O(CH_2)_2OPr$–n
$(CH_2)_2OCH_2CF_3$	CH(Me)OCH(Me)CH_2OMe	CH(Pr–n)$O(CH_2)_2OPr$–i
$(CH_2)_2O(CH_2)_2Cl$	CH(Me)OCH(Me)CH_2OEt	CH(Pr–i)$O(CH_2)_2OMe$
$(CH_2)_2O(CH_2)_2Br$	CH(Me)$OCH_2CH(Me)OMe$	CH(Pr–i)$O(CH_2)_2OEt$
CH_2OH	CH(Me)$OCH_2CH(Me)OEt$	CH(Pr–i)$O(CH_2)_2OPr$–n
CH(Me)OH	$C(Me)_2OCH_2OMe$	CH(Pr–i)$O(CH_2)_2OPr$–i
CH(Et)OH	$C(Me)_2OCH_2OEt$	$CH_2OC(O)Me$

[Tabla 15]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$CH_2OC(O)Et$	CH(Et)C(O)OEt	$CH_2S(O)Pen\text{-}n$
$CH_2OC(O)Pr\text{-}i$	CH(Et)C(O)OPr-i	$CH_2S(O)_2Pen\text{-}n$
CH(Me)OC(O)Me	$CH(Et)C(O)OCH_2OMe$	$CH_2SPen\text{-}i$
CH(Me)OC(O)Et	$CH(Et)C(O)O(CH_2)_2OMe$	$CH_2S(O)Pen\text{-}i$
CH(Me)OC(O)Pr-i	$CH(Et)C(O)O(CH_2)_2OEt$	$CH_2S(O)_2Pen\text{-}i$
CH(Et)OC(O)Me	$CH(Et)C(O)O(CH_2)_2OPr\text{-}i$	$CH_2SPen\text{-}s$
CH(Et)OC(O)Et	$(CH_2)_2C(O)OMe$	$CH_2S(O)Pen\text{-}s$
CH(Et)OC(O)Pr-i	$(CH_2)_2C(O)OEt$	$CH_2S(O)_2Pen\text{-}s$
CH_2OPh	$(CH_2)_2C(O)O(CH_2)_2OMe$	$CH_2SPen\text{-}t$
CH(Me)OPh	$(CH_2)_2C(O)O(CH_2)_2OEt$	$CH_2S(O)Pen\text{-}t$
$CH_2C(O)OMe$	CH_2SMe	$CH_2S(O)_2Pen\text{-}t$
$CH_2C(O)OEt$	$CH_2S(O)Me$	$CH_2SHex\text{-}n$
$CH_2C(O)OPr\text{-}n$	$CH_2S(O)_2Me$	CH(Me)SMe
$CH_2C(O)OPr\text{-}i$	CH_2SEt	CH(Me)S(O)Me
$CH_2C(O)OBu\text{-}n$	$CH_2S(O)Et$	$CH(Me)S(O)_2Me$
$CH_2C(O)OBu\text{-}i$	$CH_2S(O)_2Et$	CH(Me)SEt
$CH_2C(O)OBu\text{-}s$	$CH_2SPr\text{-}n$	CH(Me)S(O)Et
$CH_2C(O)OBu\text{-}t$	$CH_2S(O)Pr\text{-}n$	$CH(Me)S(O)_2Et$
$CH_2C(O)OPen\text{-}n$	$CH_2S(O)_2Pr\text{-}n$	CH(Me)SPr-n
$CH_2C(O)OPen\text{-}i$	$CH_2SPr\text{-}i$	CH(Me)S(O)Pr-n
$CH_2C(O)OPen\text{-}s$	$CH_2S(O)Pr\text{-}i$	$CH(Me)S(O)_2Pr\text{-}n$
$CH_2C(O)OPen\text{-}t$	$CH_2S(O)_2Pr\text{-}i$	CH(Me)SPr-i
$CH_2C(O)OHex\text{-}n$	$CH_2SBu\text{-}n$	CH(Me)S(O)Pr-i
$CH_2C(O)OCH_2OMe$	$CH_2S(O)Bu\text{-}n$	$CH(Me)S(O)_2Pr\text{-}i$
$CH_2C(O)O(CH_2)_2OMe$	$CH_2S(O)_2Bu\text{-}n$	CH(Me)SBu-n
$CH_2C(O)O(CH_2)_2OEt$	$CH_2SBu\text{-}i$	CH(Me)S(O)Bu-n
$CH_2C(O)O(CH_2)_2OPr\text{-}i$	$CH_2S(O)Bu\text{-}i$	$CH(Me)S(O)_2Bu\text{-}n$
CH(Me)C(O)OMe	$CH_2S(O)_2Bu\text{-}i$	CH(Me)SBu-i
CH(Me)C(O)OEt	$CH_2SBu\text{-}s$	CH(Me)S(O)Bu-i
CH(Me)C(O)OPr-i	$CH_2S(O)Bu\text{-}s$	$CH(Me)S(O)_2Bu\text{-}i$
$CH(Me)C(O)OCH_2OMe$	$CH_2S(O)_2Bu\text{-}s$	CH(Me)SBu-s
$CH(Me)C(O)O(CH_2)_2OMe$	$CH_2SBu\text{-}t$	CH(Me)S(O)Bu-s
$CH(Me)C(O)O(CH_2)_2OEt$	$CH_2S(O)Bu\text{-}t$	$CH(Me)S(O)_2Bu\text{-}s$
$CH(Me)C(O)O(CH_2)_2OPr\text{-}i$	$CH_2S(O)_2Bu\text{-}t$	CH(Me)SBu-t
CH(Et)C(O)OMe	$CH_2SPen\text{-}n$	CH(Me)S(O)Bu-t

[Tabla 16]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$CH(Me)S(O)_2Bu\text{-}t$	$C(Me)_2SBu\text{-}t$	$CH(Me)CH_2S(O)_2Me$
$CH(Me)SPen\text{-}n$	$C(Me)_2S(O)Bu\text{-}t$	$CH(Me)CH_2SEt$
$CH(Me)S(O)Pen\text{-}n$	$C(Me)_2S(O)_2Bu\text{-}t$	$CH(Me)CH_2S(O)Et$
$CH(Me)S(O)_2Pen\text{-}n$	$C(Me)_2SPen\text{-}n$	$CH(Me)CH_2S(O)_2Et$
$CH(Me)SPen\text{-}i$	$C(Me)_2S(O)Pen\text{-}n$	$CH(Me)CH_2SPr\text{-}n$
$CH(Me)S(O)Pen\text{-}i$	$C(Me)_2S(O)_2Pen\text{-}n$	$CH(Me)CH_2S(O)Pr\text{-}n$
$CH(Me)S(O)_2Pen\text{-}i$	$C(Me)_2SPen\text{-}i$	$CH(Me)CH_2S(O)_2Pr\text{-}n$
$CH(Me)SPen\text{-}s$	$C(Me)_2S(O)Pen\text{-}i$	$CH(Me)CH_2SPr\text{-}i$
$CH(Me)S(O)Pen\text{-}s$	$C(Me)_2S(O)_2Pen\text{-}i$	$CH(Me)CH_2S(O)Pr\text{-}i$
$CH(Me)S(O)_2Pen\text{-}s$	$C(Me)_2SPen\text{-}s$	$CH(Me)CH_2S(O)_2Pr\text{-}i$
$CH(Me)SPen\text{-}t$	$C(Me)_2S(O)Pen\text{-}s$	$CH(Et)CH_2SMe$
$CH(Me)S(O)Pen\text{-}t$	$C(Me)_2S(O)_2Pen\text{-}s$	$CH(Et)CH_2S(O)Me$
$CH(Me)S(O)_2Pen\text{-}t$	$C(Me)_2SPen\text{-}t$	$CH(Et)CH_2S(O)_2Me$
$CH(Me)SHex\text{-}n$	$C(Me)_2S(O)Pen\text{-}t$	$CH(Et)CH_2SEt$
$C(Me)_2SMe$	$C(Me)_2S(O)_2Pen\text{-}t$	$CH(Et)CH_2S(O)Et$
$C(Me)_2S(O)Me$	$(CH_2)_2SMe$	$CH(Et)CH_2S(O)_2Et$
$C(Me)_2S(O)_2Me$	$(CH_2)_2S(O)Me$	$C(Me)_2CH_2SMe$
$C(Me)_2SEt$	$(CH_2)_2S(O)_2Me$	$C(Me)_2CH_2S(O)Me$
$C(Me)_2S(O)Et$	$(CH_2)_2SEt$	$C(Me)_2CH_2S(O)_2Me$
$C(Me)_2S(O)_2Et$	$(CH_2)_2S(O)Et$	$C(Me)_2CH_2SEt$
$C(Me)_2SPr\text{-}n$	$(CH_2)_2S(O)_2Et$	$C(Me)_2CH_2S(O)Et$
$C(Me)_2S(O)Pr\text{-}n$	$(CH_2)_2SPr\text{-}n$	$C(Me)_2CH_2S(O)_2Et$
$C(Me)_2S(O)_2Pr\text{-}n$	$(CH_2)_2S(O)Pr\text{-}n$	$C(Me)_2CH_2SPr\text{-}n$
$C(Me)_2SPr\text{-}i$	$(CH_2)_2S(O)_2Pr\text{-}n$	$C(Me)_2CH_2S(O)Pr\text{-}n$
$C(Me)_2S(O)Pr\text{-}i$	$(CH_2)_2SPr\text{-}i$	$C(Me)_2CH_2S(O)_2Pr\text{-}n$
$C(Me)_2S(O)_2Pr\text{-}i$	$(CH_2)_2S(O)Pr\text{-}i$	$C(Me)_2CH_2SPr\text{-}i$
$C(Me)_2SBu\text{-}n$	$(CH_2)_2S(O)_2Pr\text{-}i$	$C(Me)_2CH_2S(O)Pr\text{-}i$
$C(Me)_2S(O)Bu\text{-}n$	$(CH_2)_3SMe$	$C(Me)_2CH_2S(O)_2Pr\text{-}i$
$C(Me)_2S(O)_2Bu\text{-}n$	$(CH_2)_3S(O)Me$	$CH(Et)SMe$
$C(Me)_2SBu\text{-}i$	$(CH_2)_3S(O)_2Me$	$CH(Et)S(O)Me$
$C(Me)_2S(O)Bu\text{-}i$	$(CH_2)_3SEt$	$CH(Et)S(O)_2Me$
$C(Me)_2S(O)_2Bu\text{-}i$	$(CH_2)_3S(O)Et$	$CH(Et)SEt$
$C(Me)_2SBu\text{-}s$	$(CH_2)_3S(O)_2Et$	$CH(Et)S(O)Et$
$C(Me)_2S(O)Bu\text{-}s$	$CH(Me)CH_2SMe$	$CH(Et)S(O)_2Et$
$C(Me)_2S(O)_2Bu\text{-}s$	$CH(Me)CH_2S(O)Me$	$CH(Et)SPr\text{-}n$

[Tabla 17]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
CH(Et)S(O)Pr-n	$CH_2SCH_2CF_2H$	$CH(Me)S(O)(CH_2)_2CF_3$
CH(Et)$S(O)_2$Pr-n	$CH_2S(O)CH_2CF_2H$	$CH(Me)S(O)_2(CH_2)_2CF_3$
CH(Et)SPr-i	$CH_2S(O)_2CH_2CF_2H$	$CH(Me)S(CH_2)_2Cl$
CH(Et)S(O)Pr-i	$CH_2SCH_2CF_3$	$CH(Me)S(O)(CH_2)_2Cl$
CH(Et)$S(O)_2$Pr-i	$CH_2S(O)CH_2CF_3$	$CH(Me)S(O)_2(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-n)SMe	$CH_2S(O)_2CH_2CF_3$	$CH(Me)S(CH_2)_2Br$
CH(Pr-n)S(O)Me	$CH_2S(CH_2)_2CF_3$	$CH(Me)S(O)(CH_2)_2Br$
CH(Pr-n)$S(O)_2$Me	$CH_2S(O)(CH_2)_2CF_3$	$CH(Me)S(O)_2(CH_2)_2Br$
CH(Pr-n)SEt	$CH_2S(O)_2(CH_2)_2CF_3$	$C(Me)_2SCF_2H$
CH(Pr-n)S(O)Et	$CH_2S(CH_2)_2Cl$	$C(Me)_2S(O)CF_2H$
CH(Pr-n)$S(O)_2$Et	$CH_2S(O)(CH_2)_2Cl$	$C(Me)_2S(O)_2CF_2H$
CH(Pr-n)SPr-n	$CH_2S(O)_2(CH_2)_2Cl$	$C(Me)_2SCF_3$
CH(Pr-n)S(O)Pr-n	$CH_2S(CH_2)_2Br$	$C(Me)_2S(O)CF_3$
CH(Pr-n)$S(O)_2$Pr-n	$CH_2S(O)(CH_2)_2Br$	$C(Me)_2S(O)_2CF_3$
CH(Pr-n)SPr-i	$CH_2S(O)_2(CH_2)_2Br$	$C(Me)_2SCH_2CF_2H$
CH(Pr-n)S(O)Pr-i	$CH_2SCHFCH_3$	$C(Me)_2S(O)CH_2CF_2H$
CH(Pr-n)$S(O)_2$Pr-i	$CH_2SCF_2CH_3$	$C(Me)_2S(O)_2CH_2CF_2H$
CH(Pr-i)SMe	$CH_2SCF(CH_3)_2$	$C(Me)_2SCH_2CF_3$
CH(Pr-i)S(O)Me	$CH_2SCF_2CF_2H$	$C(Me)_2S(O)CH_2CF_3$
CH(Pr-i)$S(O)_2$Me	$CH_2SCF_2CF_3$	$C(Me)_2S(O)_2CH_2CF_3$
CH(Pr-i)SEt	$CH_2SCF_2CF_2CF_3$	$C(Me)_2S(CH_2)_2CF_3$
CH(Pr-i)S(O)Et	$CH_2SCF(CF_3)_2$	$C(Me)_2S(O)(CH_2)_2CF_3$
CH(Pr-i)$S(O)_2$Et	$CH(Me)SCF_2H$	$C(Me)_2S(O)_2(CH_2)_2CF_3$
CH(Pr-i)SPr-n	$CH(Me)S(O)CF_2H$	$C(Me)_2S(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-i)S(O)Pr-n	$CH(Me)S(O)_2CF_2H$	$C(Me)_2S(O)(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-i)$S(O)_2$Pr-n	$CH(Me)SCF_3$	$C(Me)_2S(O)_2(CH_2)_2Cl$
CH(Pr-i)SPr-i	$CH(Me)S(O)CF_3$	$C(Me)_2S(CH_2)_2Br$
CH(Pr-i)S(O)Pr-i	$CH(Me)S(O)_2CF_3$	$C(Me)_2S(O)(CH_2)_2Br$
CH(Pr-i)$S(O)_2$Pr-i	$CH(Me)SCH_2CF_2H$	$C(Me)_2S(O)_2(CH_2)_2Br$
CH_2SCF_2H	$CH(Me)S(O)CH_2CF_2H$	$(CH_2)_2SCF_3$
$CH_2S(O)CF_2H$	$CH(Me)S(O)_2CH_2CF_2H$	$(CH_2)_2S(O)CF_3$
$CH_2S(O)_2CF_2H$	$CH(Me)SCH_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)_2CF_3$
CH_2SCF_3	$CH(Me)S(O)CH_2CF_3$	$(CH_2)_2SCH_2CF_2H$
$CH_2S(O)CF_3$	$CH(Me)S(O)_2CH_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)CH_2CF_2H$
$CH_2S(O)_2CF_3$	$CH(Me)S(CH_2)_2CF_3$	$(CH_2)_2S(O)_2CH_2CF_2H$

[Tabla 18]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$(CH_2)_2SCH_2CF_3$	3-Cl-Ph	2-Cl-3-Me-Ph
$(CH_2)_2S(O)CH_2CF_3$	4-Cl-Ph	2-Cl-4-Me-Ph
$(CH_2)_2S(O)_2CH_2CF_3$	2-Br-Ph	2-Cl-5-Me-Ph
$(CH_2)_2S(CH_2)_2Cl$	3-Br-Ph	3-Cl-4-Me-Ph
$(CH_2)_2S(O)(CH_2)_2Cl$	4-Br-Ph	3-Cl-5-Me-Ph
$(CH_2)_2S(O)_2(CH_2)_2Cl$	2-Me-Ph	2-Cl-3-F-Ph
$(CH_2)_2S(CH_2)_2Br$	3-Me-Ph	2-Cl-4-F-Ph
$(CH_2)_2S(O)(CH_2)_2Br$	4-Me-Ph	2-Cl-5-F-Ph
$(CH_2)_2S(O)_2(CH_2)_2Br$	2-MeO-Ph	3-Cl-4-F-Ph
$CH=CH_2$	3-MeO-Ph	3-Cl-5-F-Ph
CH=CHMe	4-MeO-Ph	2-F-3-Me-Ph
$CH=CMe_2$	2,3-$(F)_2$-Ph	2-F-4-Me-Ph
$CH_2CH=CH_2$	2,4-$(F)_2$-Ph	2-F-5-Me-Ph
$CH_2CH=CHMe$	2,5-$(F)_2$-Ph	3-F-4-Me-Ph
$CH_2C(Me)=CH_2$	2,6-$(F)_2$-Ph	3-F-5-Me-Ph
$(CH_2)_2CH=CMe_2$	3,4-$(F)_2$-Ph	2-F-3-Cl-Ph
$C(Me)=CH_2$	3,5-$(F)_2$-Ph	2-F-4-Cl-Ph
C(Me)=CHMe	2,3-$(Cl)_2$-Ph	2-F-5-Cl-Ph
$C(Me)=CMe_2$	2,4-$(Cl)_2$-Ph	3-F-4-Cl-Ph
$CH(Me)CH=CH_2$	2,5-$(Cl)_2$-Ph	3-F-5-Cl-Ph
$C(Et)=CH_2$	2,6-$(Cl)_2$-Ph	2-Me-3-F-Ph
C(Et)=CHMe	3,4-$(Cl)_2$-Ph	2-Me-4-F-Ph
$C(Et)=CMe_2$	3,5-$(Cl)_2$-Ph	2-Me-5-F-Ph
$CH(Et)CH=CH_2$	2,3-$(Me)_2$-Ph	3-Me-4-F-Ph
C≡CH	2,4-$(Me)_2$-Ph	3-Me-5-F-Ph
C≡CMe	2,5-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-3-MeO-Ph
$CH_2C≡CH$	2,6-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-4-MeO-Ph
$CH_2C≡CMe$	3,4-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-5-MeO-Ph
CH(Me)C≡CH	3,5-$(Me)_2$-Ph	2-Cl-6-MeO-Ph
CH(Me)C≡CMe	2,3-$(MeO)_2$-Ph	3-Cl-4-MeO-Ph
Ph	2,4-$(MeO)_2$-Ph	3-Cl-5-MeO-Ph
2-F-Ph	2,5-$(MeO)_2$-Ph	2-F-3-MeO-Ph
3-F-Ph	2,6-$(MeO)_2$-Ph	2-F-4-MeO-Ph
4-F-Ph	3,4-$(MeO)_2$-Ph	2-F-5-MeO-Ph
2-Cl-Ph	3,5-$(MeO)_2$-Ph	2-F-6-MeO-Ph

[Tabla 19]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
3-F-4-MeO-Ph	D-8	CH_2(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
3-F-5-MeO-Ph	D-8a	CH_2(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-3-F-Ph	D-8b	CH_2(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-4-F-Ph	D-8c	CH_2(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-5-F-Ph	D-8d	CH_2(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-6-F-Ph	D-8e	CH(Me)(2-MeO-Ph)
3-MeO-4-F-Ph	D-8f	CH(Me)(3-MeO-Ph)
3-MeO-5-F-Ph	D-8g	CH(Me)(4-MeO-Ph)
2-MeO-3-Cl-Ph	D-8h	CH(Me)(2,3-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-4-Cl-Ph	D-10a	CH(Me)(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-5-Cl-Ph	D-11	CH(Me)(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
2-MeO-6-Cl-Ph	D-14	CH(Me)(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
3-MeO-4-Cl-Ph	D-16	CH(Me)(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
3-MeO-5-Cl-Ph	D-16a	CH(Me)(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
2-Me-3-MeO-Ph	D-16b	CH(Et)(2-MeO-Ph)
2-Me-4-MeO-Ph	D-16c	CH(Et)(3-MeO-Ph)
2-Me-5-MeO-Ph	D-16d	CH(Et)(4-MeO-Ph)
2-Me-6-MeO-Ph	D-16e	$(CH_2)_2$(2-MeO-Ph)
3-Me-4-MeO-Ph	D-16f	$(CH_2)_2$(3-MeO-Ph)
3-Me-5-MeO-Ph	D-16g	$(CH_2)_2$(4-MeO-Ph)
2-MeO-3-Me-Ph	D-16h	CHO
2-MeO-4-Me-Ph	D-16i	SMe
2-MeO-5-Me-Ph	D-16j	S(O)Me
2-MeO-6-Me-Ph	D-16k	$S(O)_2$Me
3-MeO-4-Me-Ph	D-16m	SEt
3-MeO-5-Me-Ph	D-16n	S(O)Et
3,5-$(F)_2$-4-Me-Ph	D-16p	$S(O)_2$Et
3,5-$(F)_2$-4-MeO-Ph	D-17	SPr-n
3,4,5-$(MeO)_3$-Ph	D-17a	S(O)Pr-n
D-3	D-17b	$S(O)_2$Pr-n
D-3a	CH_2Ph	SPr-i
D-4	CH_2(2-MeO-Ph)	S(O)Pr-i
D-4a	CH_2(3-MeO-Ph)	$S(O)_2$Pr-i
D-4b	CH_2(4-MeO-Ph)	SPr-c
D-5	CH_2(2,3-$(MeO)_2$-Ph)	S(O)Pr-c

[Tabla 20]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$S(O)_2Pr-c$	S(O)Pen-t	$SCHFCH_3$
S(D-16)	$S(O)_2Pen-t$	SCF_2CH_3
S(O)(D-16)	SHex-n	$SCF(CH_3)_2$
$S(O)_2$(D-16)	SHex-c	SCF_2CF_2H
S(D-16e)	$SCH_2CH=CH_2$	SCF_2CF_3
S(O)(D-16e)	$S(O)CH_2CH=CH_2$	$SCF_2CF_2CF_3$
$S(O)_2$(D-16e)	$S(O)_2CH_2CH=CH_2$	$SCF(CF_3)$
SBu-n	$SCH(Me)CH=CH_2$	SCH_2OMe
S(O)Bu-n	$SC(Me)_2CH=CH_2$	$S(CH_2)_2OMe$
$S(O)_2Bu-n$	$SCH_2CH=CHMe$	$S(O)(CH_2)_2OMe$
SBu-i	$SCH_2C(Me)=CH_2$	$S(O)_2(CH_2)_2OMe$
S(O)Bu-i	$S(CH_2)_2CH=CMe_2$	$SCH(Me)CH_2OMe$
$S(O)_2Bu-i$	$SC(Me)=CH_2$	$S(O)CH(Me)CH_2OMe$
SBu-c	SC(Me)=CH(Me)	$S(O)_2CH(Me)CH_2OMe$
S(O)Bu-c	$SCH_2C\equiv CH$	$SCH_2CH(Me)OMe$
$S(O)_2Bu-c$	$S(O)CH_2C\equiv CH$	$S(O)CH_2CH(Me)OMe$
SBu-s	$S(O)_2CH_2C\equiv CH$	$S(O)_2CH_2CH(Me)OMe$
S(O)Bu-s	$SCH(Me)C\equiv CH$	$SC(Me)_2CH_2OMe$
$S(O)_2Bu-s$	$SC(Me)_2C\equiv CH$	$S(CH_2)_3OMe$
SBu-t	$SCH_2C\equiv CMe$	SCH_2OEt
S(O)Bu-t	SCH_2Cl	$S(CH_2)_2OEt$
$S(O)_2Bu-t$	SCH(Me)Cl	$S(O)(CH_2)_2OEt$
SPen-n	$S(CH_2)_2Cl$	$S(O)_2(CH_2)_2OEt$
S(O)Pen-n	$S(O)(CH_2)_2Cl$	$SCH(Me)CH_2OEt$
$S(O)_2Pen-n$	$S(O)_2(CH_2)_2Cl$	SCH_2OPr-i
SPen-i	$SCH(Me)CH_2Cl$	$S(CH_2)_2OPr-i$
S(O)Pen-i	$SCH_2CH(Me)Cl$	$S(O)(CH_2)_2OPr-i$
$S(O)_2Pen-i$	$S(CH_2)_3Cl$	$S(O)_2(CH_2)_2OPr-i$
SPen-c	SCF_3	$SCH(Me)CH_2OPr-i$
S(O)Pen-c	SCH_2CF_3	SCH_2Pr-c
$S(O)_2Pen-c$	$S(O)CH_2CF_3$	$S(O)CH_2Pr-c$
SPen-s	$S(O)_2CH_2CF_3$	$S(O)_2CH_2Pr-c$
S(O)Pen-s	$SCH(Me)CF_3$	SCH(Me)Pr-c
$S(O)_2Pen-s$	$S(CH_2)_2CF_3$	S(O)CH(Me)Pr-c
SPen-t	$S(CH_2)_3CF_3$	$S(O)_2CH(Me)Pr-c$

[Tabla 21]

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
$S(CH_2)_2Pr$-c	SCH(Me)Ph	SCH_2(D-8f)
SCH_2(D-16)	S(O)CH(Me)Ph	$S(O)_2CH_2$(D-8f)
$S(O)CH_2$(D-16)	$S(O)_2CH$(Me)Ph	SCH_2(D-8g)
$S(O)_2CH_2$(D-16)	SCH_2(2-MeO-Ph)	$S(O)_2CH_2$(D-8g)
SCH_2(D-16e)	$S(O)CH_2$(2-MeO-Ph)	SCH_2(D-8h)
$S(O)CH_2$(D-16e)	$S(O)_2CH_2$(2-MeO-Ph)	$S(O)_2CH_2$(D-8h)
$S(O)_2CH_2$(D-16e)	SCH(Me)(2-MeO-Ph)	SCH_2(D-15)
SCH_2Bu-c	S(O)CH(Me)(2-MeO-Ph)	$S(O)CH_2$(D-15)
$S(O)CH_2$Bu-c	$S(O)_2CH$(Me)(2-MeO-Ph)	$S(O)_2CH_2$(D-15)
$S(O)_2CH_2$Bu-c	SCH_2(3-MeO-Ph)	SCH(Me)(D-15)
SCH(Me)Bu-c	$S(O)CH_2$(3-MeO-Ph)	S(O)CH(Me)(D-15)
$S(CH_2)_2$Bu-c	$S(O)_2CH_2$(3-MeO-Ph)	$S(O)_2CH$(Me)(D-15)
SCH_2Pen-c	SCH(Me)(3-MeO-Ph)	$S(CH_2)_2$(D-15)
$S(O)CH_2$Pen-c	S(O)CH(Me)(3-MeO-Ph)	$S(O)(CH_2)_2$(D-15)
$S(O)_2CH_2$Pen-c	$S(O)_2CH$(Me)(3-MeO-Ph)	$S(O)_2(CH_2)_2$(D-15)
SCH(Me)Pen-c	SCH_2(4-MeO-Ph)	NHMe
$S(CH_2)_2$Pen-c	$S(O)CH_2$(4-MeO-Ph)	NHEt
SCH_2Hex-c	$S(O)_2CH_2$(4-MeO-Ph)	NHPr-n
SCH(Me)Hex-c	SCH(Me)(4-MeO-Ph)	NHPr-i
$S(CH_2)_2$Hex-c	S(O)CH(Me)(4-MeO-Ph)	NHPr-c
SCH_2CN	$S(O)_2CH$(Me)(4-MeO-Ph)	NH(D-16)
$S(O)CH_2CN$	SCH_2(D-8a)	NH(D-16e)
$S(O)_2CH_2CN$	$S(O)CH_2$(D-8a)	NHBu-n
SCH(Me)CN	$S(O)_2CH_2$(D-8a)	NHBu-i
S(O)CH(Me)CN	SCH_2(D-8b)	NHBu-c
$S(O)_2CH$(Me)CN	$S(O)CH_2$(D-8b)	NHBu-s
$SC(Me)_2CN$	$S(O)_2CH_2$(D-8b)	NHBu-t
$S(O)C(Me)_2CN$	SCH_2(D-8c)	NHPen-n
$S(O)_2C(Me)_2CN$	$S(O)CH_2$(D-8c)	NHPen-i
$S(CH_2)_2CN$	$S(O)_2CH_2$(D-8c)	NHPen-c
$S(O)(CH_2)_2CN$	SCH_2(D-8d)	NHPen-s
$S(O)_2(CH_2)_2CN$	$S(O)CH_2$(D-8d)	NHPen-t
SCH_2Ph	$S(O)_2CH_2$(D-8d)	NH(3-Pen)
$S(O)CH_2Ph$	SCH_2(D-8e)	NHHex-n
$S(O)_2CH_2Ph$	$S(O)_2CH_2$(D-8e)	NHHex-c

[Tabla 22]

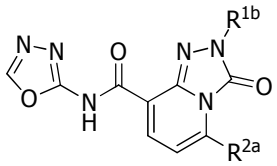
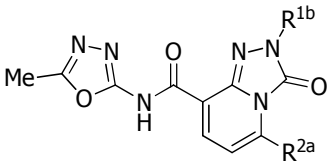
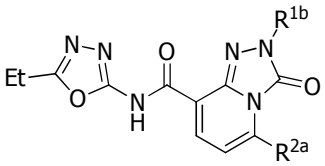
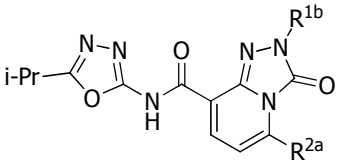
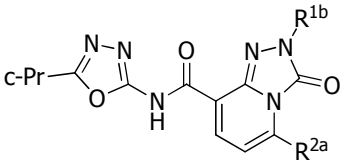
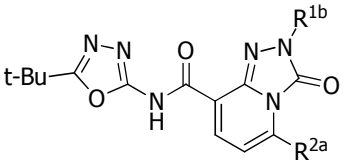
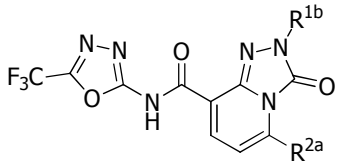
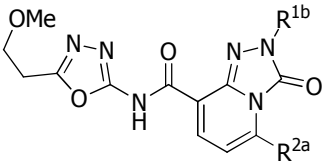
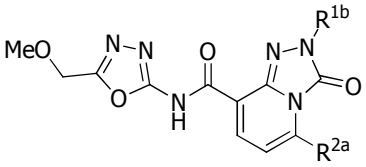
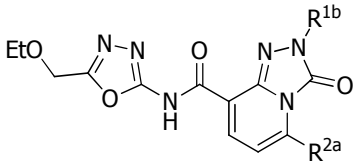
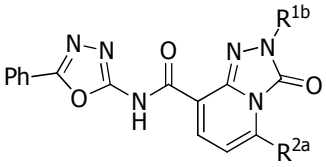
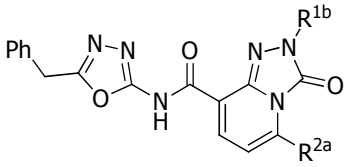
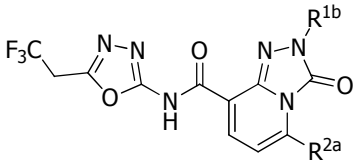
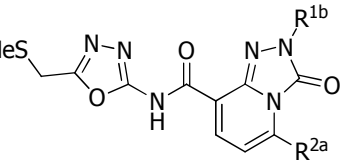
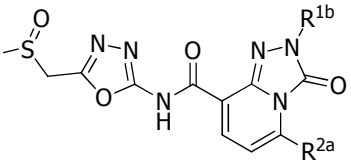
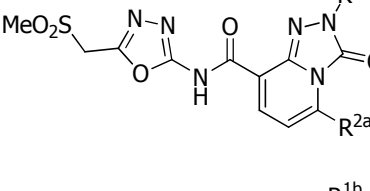
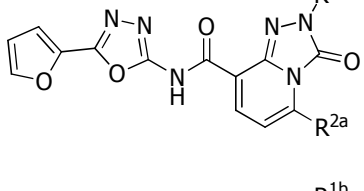
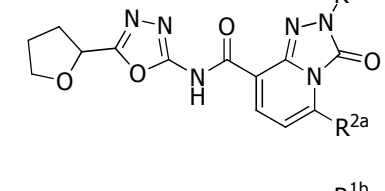
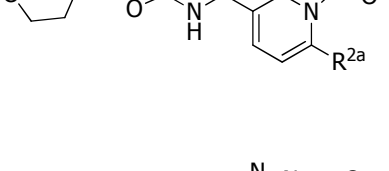
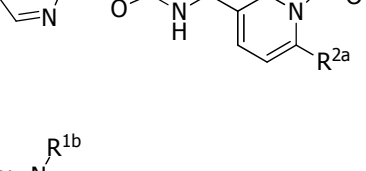
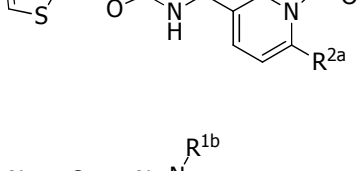
R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
N(Me)Me	N(Pr-n)Bu-n	N(Et)$(CH_2)_2$OEt
N(Me)Et	N(Pr-n)Bu-i	N(Et)$(CH_2)_2$OPr-n
N(Me)Pr-n	N(Pr-n)Bu-c	N(Et)$(CH_2)_2$OPr-i
N(Me)Pr-i	N(Pr-n)Bu-s	N(Pr-n)$(CH_2)_2$OMe
N(Me)Pr-c	N(Pr-i)Pr-i	N(Pr-n)$(CH_2)_2$OEt
N(Me)(D-16)	N(Pr-i)Pr-c	N(Pr-n)$(CH_2)_2$OPr-n
N(Me)(D-16e)	N(Pr-i)(D-16)	N(Pr-n)$(CH_2)_2$OPr-i
N(Me)Bu-n	N(Pr-i)(D-16e)	N(Pr-i)$(CH_2)_2$OMe
N(Me)Bu-i	N(Pr-i)Bu-n	N(Pr-i)$(CH_2)_2$OEt
N(Me)Bu-c	N(Pr-i)Bu-i	N(Pr-i)$(CH_2)_2$OPr-n
N(Me)Bu-s	N(Pr-i)Bu-c	N(Pr-i)$(CH_2)_2$OPr-i
N(Me)Bu-t	N(Pr-i)Bu-s	$NHCH_2SMe$
N(Me)Pen-n	$NHCH_2OMe$	$NHCH_2SEt$
N(Me)Pen-i	$NHCH_2OEt$	NHCH(Me)SMe
N(Me)Pen-c	NHCH(Me)OMe	NHCH(Me)SEt
N(Me)Pen-s	NHCH(Me)OEt	$NHC(Me)_2SMe$
N(Me)Pen-t	$NHC(Me)_2OMe$	$NHC(Me)_2SEt$
N(Me)(3-Pen)	$NHC(Me)_2OEt$	$NH(CH_2)_2SMe$
N(Me)Hex-n	$NH(CH_2)_2OMe$	$NH(CH_2)_2S(O)Me$
N(Me)Hex-c	$NH(CH_2)_2OEt$	$NH(CH_2)_2S(O)_2Me$
N(Et)Et	$NH(CH_2)_2OPr$-n	$NH(CH_2)_2SEt$
N(Et)Pr-n	$NH(CH_2)_2OPr$-i	$NH(CH_2)_2S(O)Et$
N(Et)Pr-i	$N(Me)CH_2OMe$	$NH(CH_2)_2S(O)_2Et$
N(Et)Pr-c	$N(Me)CH_2OEt$	$NH(CH_2)_2SPr$-i
N(Et)(D-16)	N(Me)CH(Me)OMe	$NH(CH_2)_2S(O)Pr$-i
N(Et)(D-16e)	N(Me)CH(Me)OEt	$NH(CH_2)_2S(O)_2Pr$-i
N(Et)Bu-n	$N(Me)C(Me)_2OMe$	$N(Me)CH_2SMe$
N(Et)Bu-i	$N(Me)C(Me)_2OEt$	$N(Me)CH_2SEt$
N(Et)Bu-c	$N(Me)(CH_2)_2OMe$	N(Me)CH(Me)SMe
N(Et)Bu-s	$N(Me)(CH_2)_2OEt$	N(Me)CH(Me)SEt
N(Pr-n)Pr-n	$N(Me)(CH_2)_2OPr$-n	$N(Me)C(Me)_2SMe$
N(Pr-n)Pr-i	$N(Me)(CH_2)_2OPr$-i	$N(Me)C(Me)_2SEt$
N(Pr-n)Pr-c	$N(Et)C(Me)_2OMe$	$N(Me)(CH_2)_2SMe$
N(Pr-n)(D-16)	$N(Et)C(Me)_2OEt$	$N(Me)(CH_2)_2S(O)Me$
N(Pr-n)(D-16e)	$N(Et)(CH_2)_2OMe$	$N(Me)(CH_2)_2S(O)_2Me$

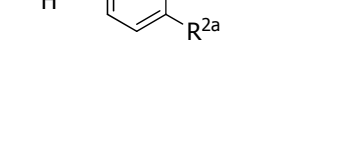
[Tabla 23]

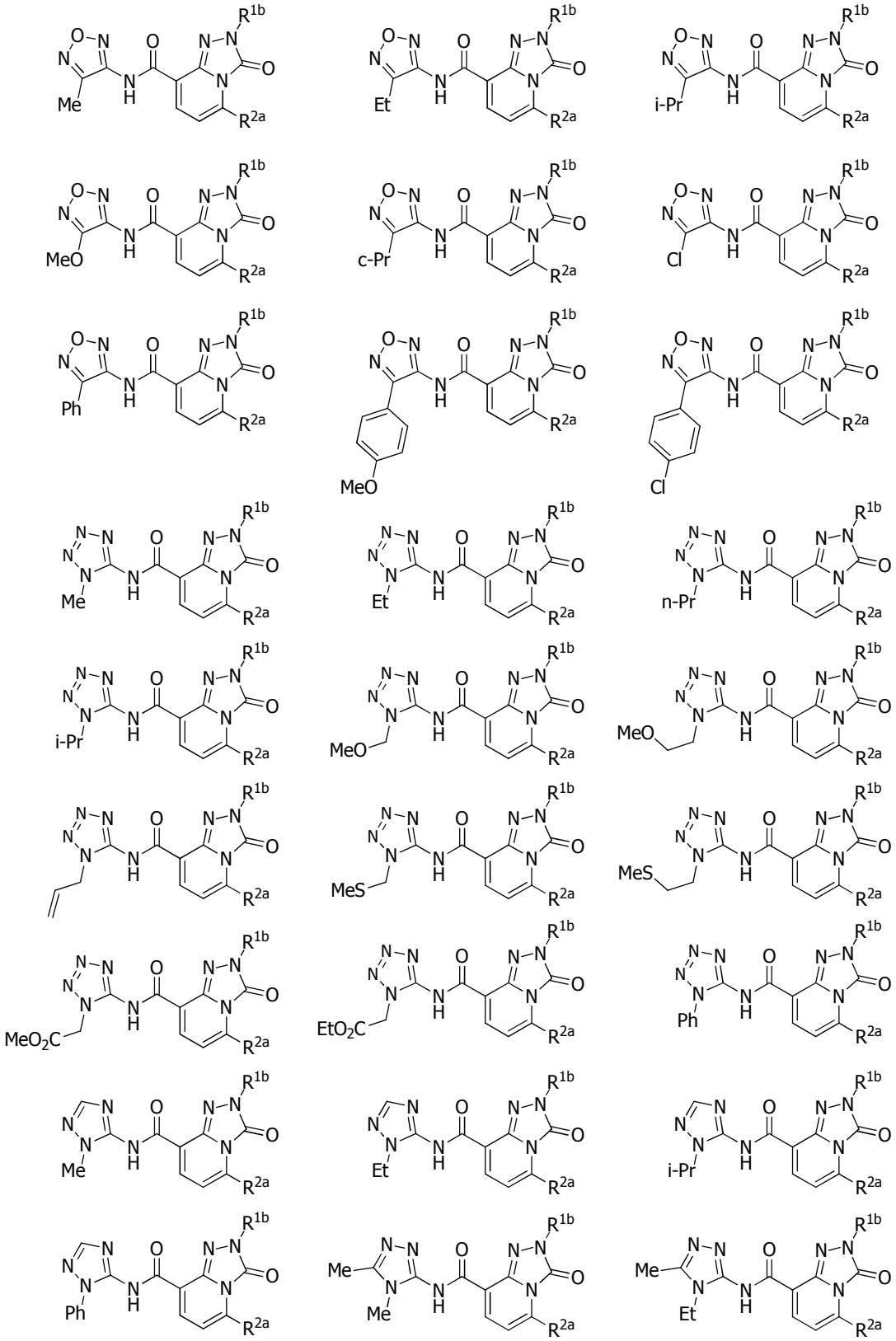
R^{1a}
N(Me)$(CH_2)_2$SEt
N(Me)$(CH_2)_2$S(O)Et
N(Me)$(CH_2)_2$S$(O)_2$Et
N(Me)$(CH_2)_2$SPr-i
N(Me)$(CH_2)_2$S(O)Pr-i
N(Me)$(CH_2)_2$S$(O)_2$Pr-i
NHCF_2H
NHCF_3
NHCH_2CF_2H
NHCH_2CF_3
NH$(CH_2)_2CF_3$
NH$(CH_2)_2$Cl
NH$(CH_2)_3$Cl
N(Me)CF_2H
N(Me)CF_3
N(Me)CH_2CF_2H
N(Me)CH_2CF_3
N(Me)$(CH_2)_2CF_3$
N(Me)$(CH_2)_2$Cl
N(Me)$(CH_2)_3$Cl
NHCH_2CH=CH_2
N(Me)CH_2CH=CH_2
NHCH_2C≡CH
NHCH_2C≡CMe
N(Me)CH_2C≡CH
N(Me)CH_2C≡CMe
NHCH_2CN
NH$(CH_2)_2$CN
NH$(CH_2)_3$CN
N(Me)CH_2CN
N(Me)$(CH_2)_2$CN
N(Me)$(CH_2)_3$CN
NHPh
NH(2-MeO-Ph)
NH(3-MeO-Ph)

R^{1a}
NH(4-MeO-Ph)
NH(2,3-$(MeO)_2$-Ph)
NH(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
NH(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
NH(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
NH(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
NH(3,5-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)Ph
N(Me)(2-MeO-Ph)
N(Me)(3-MeO-Ph)
N(Me)(4-MeO-Ph)
N(Me)(2,3-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(2,4-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(2,5-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(2,6-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(3,4-$(MeO)_2$-Ph)
N(Me)(3,5-$(MeO)_2$-Ph)

[0191] [Tercera Tabla]





[Tabla 24]

R^{2a}	R^{1b}
CF_2H	Me
CF_2H	Et
CF_2H	Pr-n
CF_2H	Pr-i
CF_2H	Pr-c
CF_2H	Bu-n
CF_2H	Bu-i
CF_2H	Bu-c
CF_2H	Bu-s
CF_2H	Bu-t
CF_2H	Pen-n
CF_2H	Pen-i
CF_2H	Pen-c
CF_2H	Pen-s
CF_2H	Pen-t
CF_2H	3-Pen
CF_2H	Hex-n
CF_2H	Hex-c
CF_2H	CH_2Ph
CF_2H	CH(Me)Ph
CF_2H	$(CH_2)_2Ph$
CF_2H	$(CH_2)_3Ph$
CF_2Cl	Me
CF_2Cl	Et
CF_2Cl	Pr-n
CF_2Cl	Pr-i
CF_2Cl	Pr-c
CF_2Cl	Bu-n
CF_2Cl	Bu-i
CF_2Cl	Bu-c
CF_2Cl	Bu-s
CF_2Cl	Bu-t
CF_2Cl	Pen-n
CF_2Cl	Pen-i

R^{2a}	R^{1b}
CF_2Cl	Pen-c
CF_2Cl	Pen-s
CF_2Cl	Pen-t
CF_2Cl	3-Pen
CF_2Cl	Hex-n
CF_2Cl	Hex-c
CF_2Cl	CH_2Ph
CF_2Cl	CH(Me)Ph
CF_2Cl	$(CH_2)_2Ph$
CF_2Cl	$(CH_2)_3Ph$
CF_2Br	Me
CF_2Br	Et
CF_2Br	Pr-n
CF_2Br	Pr-i
CF_2Br	Pr-c
CF_2Br	Bu-n
CF_2Br	Bu-i
CF_2Br	Bu-c
CF_2Br	Bu-s
CF_2Br	Bu-t
CF_2Br	CH_2Ph
CF_2Br	CH(Me)Ph
CF_3	Me
CF_3	Et
CF_3	Pr-n
CF_3	Pr-i
CF_3	Pr-c
CF_3	Bu-n
CF_3	Bu-i
CF_3	Bu-c
CF_3	Bu-s
CF_3	Bu-t
CF_3	Pen-n
CF_3	Pen-i

[Tabla 25]

R^{2a}	R^{1b}
CF_3	Pen-c
CF_3	Pen-s
CF_3	Pen-t
CF_3	3-Pen
CF_3	Hex-n
CF_3	Hex-c
CF_3	CH_2Ph
CF_3	CH(Me)Ph
CF_3	$(CH_2)_2Ph$
CF_3	$(CH_2)_3Ph$
CH_2CF_2H	Me
CH_2CF_2H	Et
CH_2CF_2H	Pr-n
CH_2CF_2H	Pr-i
CH_2CF_2H	Pr-c
CH_2CF_2H	Bu-n
CH_2CF_2H	Bu-i
CH_2CF_2H	Bu-c
CH_2CF_2H	Bu-s
CH_2CF_2H	Bu-t
CH_2CF_2H	CH_2Ph
CH_2CF_2H	CH(Me)Ph
CH_2CF_3	Me
CH_2CF_3	Et
CH_2CF_3	Pr-n
CH_2CF_3	Pr-i
CH_2CF_3	Pr-c
CH_2CF_3	Bu-n
CH_2CF_3	Bu-i
CH_2CF_3	Bu-c
CH_2CF_3	Bu-s
CH_2CF_3	Bu-t
CH_2CF_3	CH_2Ph
CH_2CF_3	CH(Me)Ph

R^{2a}	R^{1b}
$CHFCH_3$	Me
$CHFCH_3$	Et
$CHFCH_3$	Pr-n
$CHFCH_3$	Pr-i
$CHFCH_3$	Pr-c
$CHFCH_3$	Bu-n
$CHFCH_3$	Bu-i
$CHFCH_3$	Bu-c
$CHFCH_3$	Bu-s
$CHFCH_3$	Bu-t
$CHFCH_3$	CH_2Ph
$CHFCH_3$	CH(Me)Ph
CF_2CH_3	Me
CF_2CH_3	Et
CF_2CH_3	Pr-n
CF_2CH_3	Pr-i
CF_2CH_3	Pr-c
CF_2CH_3	Bu-n
CF_2CH_3	Bu-i
CF_2CH_3	Bu-c
CF_2CH_3	Bu-s
CF_2CH_3	Bu-t
CF_2CH_3	CH_2Ph
CF_2CH_3	CH(Me)Ph
$CF(CH_3)_2$	Me
$CF(CH_3)_2$	Et
$CF(CH_3)_2$	Pr-n
$CF(CH_3)_2$	Pr-i
$CF(CH_3)_2$	Pr-c
$CF(CH_3)_2$	Bu-n
$CF(CH_3)_2$	Bu-i
$CF(CH_3)_2$	Bu-c
$CF(CH_3)_2$	Bu-s
$CF(CH_3)_2$	Bu-t

[Tabla 26]

R^{2a}	R^{1b}
$CF(CH_3)_2$	CH_2Ph
$CF(CH_3)_2$	CH(Me)Ph
CF_2CF_2H	Me
CF_2CF_2H	Et
CF_2CF_2H	Pr-n
CF_2CF_2H	Pr-i
CF_2CF_2H	Pr-c
CF_2CF_2H	Bu-n
CF_2CF_2H	Bu-i
CF_2CF_2H	Bu-c
CF_2CF_2H	Bu-s
CF_2CF_2H	Bu-t
CF_2CF_2H	Pen-n
CF_2CF_2H	Pen-i
CF_2CF_2H	Pen-c
CF_2CF_2H	Pen-s
CF_2CF_2H	Pen-t
CF_2CF_2H	3-Pen
CF_2CF_2H	Hex-n
CF_2CF_2H	Hex-c
CF_2CF_2H	CH_2Ph
CF_2CF_2H	CH(Me)Ph
CF_2CF_2H	$(CH_2)_2Ph$
CF_2CF_2H	$(CH_2)_3Ph$
CF_2CF_3	Me
CF_2CF_3	Et
CF_2CF_3	Pr-n
CF_2CF_3	Pr-i
CF_2CF_3	Pr-c
CF_2CF_3	Bu-n
CF_2CF_3	Bu-i
CF_2CF_3	Bu-c
CF_2CF_3	Bu-s
CF_2CF_3	Bu-t

R^{2a}	R^{1b}
CF_2CF_3	Pen-n
CF_2CF_3	Pen-i
CF_2CF_3	Pen-c
CF_2CF_3	Pen-s
CF_2CF_3	Pen-t
CF_2CF_3	3-Pen
CF_2CF_3	Hex-n
CF_2CF_3	Hex-c
CF_2CF_3	CH_2Ph
CF_2CF_3	CH(Me)Ph
CF_2CF_3	$(CH_2)_2Ph$
CF_2CF_3	$(CH_2)_3Ph$
$CF_2CF_2CF_3$	Me
$CF_2CF_2CF_3$	Et
$CF_2CF_2CF_3$	Pr-n
$CF_2CF_2CF_3$	Pr-i
$CF_2CF_2CF_3$	Pr-c
$CF_2CF_2CF_3$	Bu-n
$CF_2CF_2CF_3$	Bu-i
$CF_2CF_2CF_3$	Bu-s
$CF_2CF_2CF_3$	Bu-t
$CF(CF_3)_2$	Me
$CF(CF_3)_2$	Et
$CF(CF_3)_2$	Pr-n
$CF(CF_3)_2$	Pr-i
$CF(CF_3)_2$	Pr-c
$CF(CF_3)_2$	Bu-n
$CF(CF_3)_2$	Bu-i
$CF(CF_3)_2$	Bu-s
$CF(CF_3)_2$	Bu-t

El compuesto de la presente invención puede ser empleado tanto para los métodos de aplicación en el suelo y la aplicación de follaje bajo las inundaciones como un herbicida para arrozales. Ejemplos de malezas de arrozales pueden incluir las malezas de hierbas Potamogetonace *Potamogetonaceae* representados por *Potamogeton distinctus;* malezas de hierbas *Alismatacea* representados por *canaliculatum Alisma, Sagittaria pygmaea* y *Sagittaria trifolia;* malezas *gramíneas* representadas por *Leptochloa chinensis, Echinochloa crus-galli, Echinochloa oryzicola, Homalocenchrus japonocus* y *Paspalum distichum*; malezas de hierbas Cyp*eracea* representados por *Eleocharis kuroguwai, juncoides Scirpus, nipponicus Scirpus, Cyperus serotinus, Cyperus difformis* y *Cyperus hakonensis*; malezas de hierbas *Lemnacea* representados por *Spirodela polyrhiza* y *Lemna paucicostata*; malezas de hierbas *Commelinacea* representados por *Murdannia keisak*; malezas de *hierbas Pontederiacea* representados por *Monochoria korsakowii* y *Monochoria vaginalis*; malezas de hierbas *elatinacea* representados por *Elatine triandra*; malezas *de hierbas Lythracea* representados por *Ammannia multiflora* y *Rotala índica;* las malas hierbas *Oenotheraceae* representados por *Lidwigia epilobioides*; malezas de hierbas Scrophulariace*a* representados por *junceum Dopatrium, Gratiola japonica, Limnophila sessilifolia, Lindernia pyxidaria* y *Lindernia dubia*; malezas de hierbas*leguminosas* como *Aeschynomene indica* y malezas de hierbas *Composita* representados *por, Bidens frondosa* y *Bidens tripartita* y similares.

El compuesto de la presente invención puede ser empleado en cualquier método de tratamiento de suelos, tratamientos de incorporación al suelo y tratamiento de follaje en campos secos y huertas. Ejemplos de maleza de campos secos pueden incluir malezas de hoja ancha tales como maleza de Solanácea que están representadas por las malezas *Solanum nigrum* y *Datura stramonium*; *Geraniaceae* representados por *Granium carolinianum*; Malvaceae representada por las malezas *Abutilon theophrasti* y *Sida spinosa*; Convolvulaceae representadas por las malezas *Ipomoea spps.* tales como *Ipomoea purpurea* y *Calystegia spps.*; Amaranthaceae representadas por las malezas *Amaranthus lividus* y *Amaranthus retroflexus*; Compositae representadas por las malezas *Xanthium pensylvanicum*, *Ambrosia artemisiaefolia*, *Helianthus annuus*, *Galinsoga ciliata*, *Cirsium arvense*, *Senecio vulgaris*, y *Erigeron annuus*; Cruciferae representadadas por las malezas *Rorippa indica*, *Sinapis arvensis*, y *Capsella Bursapastoris*; Polygonaceae representadas por las malezas *Polygonum Blumei* y *Polygonum convolvulus*; *Portulacaceae* representadas por las

malezas *Portulaca oleracea*; *Chenopodiaceae* representadas por las malezaas *Chenopodium album*, *Chenopodium ficifolium*, y *Kochia scoparia*; *Caryophyllaceae* representadas por las malezas *Stellaria media*; *Scrophulariaceae* representadas por las malezas *Veronica persica*; *Commelinaceae* representada por las malezas *Commelina communis*; *Labiatae* representadas por las malezas *Lamium amplexicaule* y *Lamium purpureum*; *Euphorbiaceae* representadas por las malezas *Euphorbia supina* y *Euphorbia maculate*; Rubiaceae representadas por las malezas *Galium spurium* y *Rubia akane*; *Violaceae* weeds represented by *Viola mandshurica*; Leguminosae representadas por las malezas *Sesbania exaltata* y *Cassia obtusifolia*; y *Oxsaldaseae* representado por *Oxsalis courniculata*; Graminaceous representadas por las malezas *Sorgham bicolor*, *Panicum dichotomiflorum*, *Sorghum halepense*, *Echinochloa crus-galli var. crus-galli*, *Echinochloa crus-galli var. praticola*, *Echinochloa utilis*, *Digitaria ciliaris*, *Avena fatua*, *Alopecurus myosuroides*, *Eleusine indica*, *Setaria viridis*, *Setaria faberi*, and *Alopecurus aegualis*; y *Cyperaceous* representadas por las malezas *Cyperus rotundus* y *Cyperus esculentus* y similares.

El compuesto de la presente invención puede ser empleado en cualquier método de tratamiento de suelos, tratamientos de incorporación al suelo y tratamiento de follaje en campos no aptos para cultivo tales como céspedes, terrenos de juego, terrenos abiertos, bermas, y verjas de ferrocarril aparte de los campos agrícolas y hortícolas, como arrozales, campos secos, y huertos. Como malezas de tierras no agrícolas, los siguientes ejemplos de malezas se ejemplifican además de las descritas como las malezas de campos secos y huertos. Ejemplos de malezas pueden incluir *Poa annua, Taraxacum officinale, Conyza sumatrensis, Cardamine flexuosa, Trifolium repens, sibthorpioides Hydrocotyle, Plantago asiatica, Cyperus brevifolius, Kyllinga brevifolia* y *Equisetum arvense* y similares.

Cuando el compuesto de la presente invención se aplica como herbicida, el compuesto generalmente se mezcla con un vehículo sólido o vehículo líquido apropiado, y se añaden agentes tensioactivos, agentes de penetración, agentes de diseminación, espesantes, agentes anticongelantes, aglutinantes, agentes antiaglomerantes, agentes de desintegración, agentes estabilizantes, y similares, si se desea. El herbicida puede aplicarse a usos prácticos por cualquier formulación herbicida de la forma herbicida tales como agentes dispersables en agua, agentes de emulsión, agentes de flujo, agentes de fluidos secos, agentes líquidos, agentes en polvo, agentes de granulado, o agentes de gel. Desde el punto de vista del ahorro de trabajo y mejora de la seguridad, cualquiera de las formulaciones herbicidas de la forma herbicida se puede aplicar en un estado

encapsulado en un paquete soluble en agua.

Ejemplos de los vehículos sólidos pueden incluir los minerales naturales, tales como cuarzo, caolinita, pirofilita, sericita, talco, bentonita, arcilla ácida, atapulgita, zeolita, y tierra de diatomeas; sales inorgánicas tales como carbonato de calcio, sulfato de amonio, sulfato de sodio y cloruro de potasio; y ácido silícico sintético y silicatos sintéticos.

Ejemplos de portadores líquidos pueden incluir alcoholes tales como etilenglicol, propilenglicol, e isopropanol; hidrocarburos aromáticos tales como xileno, alquilbenceno, y alquilnaftaleno; éteres tales como butil cellosolve; cetonas tales como ciclohexanona; ésteres tales como γ butirolactona; amidas de ácido tales como N-metil-pirrolidona y N-octilpirrolidona; aceites vegetales tales como aceite de soja, aceite de colza, aceite de semilla de algodón, y aceite de ricino; y agua.

Estos vehículos sólidos y líquidos pueden utilizarse solos o en combinaciones de dos o más de ellos.

Ejemplos del tensioactivo pueden incluir tensioactivos no iónicos tales como éteres alquílicos de polioxietileno, éteres de alquilaril polioxietileno, éteres de polioxietileno estirilfenil, copolímeros de bloque de polioxietileno-polioxipropileno, ésteres de ácido graso de polioxietileno, ésteres de ácidos grasos de sorbitán, y ésteres de ácidos grasos de polioxietileno sorbitán; tensioactivos aniónicos tales como sulfatos de alquilo, sulfonatos de alquilbenceno, sulfonatos de lignina, sulfosuccinatos de alquilo, sulfonato de naftaleno, sulfonatos de alquilnaftaleno, sales de condensado de formalina de ácido sulfónico naftaleno, sales de formalina condensado de alquilnaftaleno ácido sulfónico, sulfatos y fosfatos de polioxietilen esterilfenil, éter estirilfenílico de polioxietileno sulfatos y fosfatos, policarboxilatos, y sulfonatos de poliestireno; tensioactivos catiónicos tales como sales de alquilamina y sales de amonio cuaternario de alquilo; y tensioactivos anfóteros tales como tensioactivos de tipo amino ácido y tensioactivos de tipo betaína.

El contenido de los tensioactivos no está particularmente limitado. Por lo general, el contenido está preferiblemente dentro de un rango de 0,05 partes en peso a 20 partes en peso con respecto a 100 partes en peso de la formulación herbicida de la presente invención. Estos tensioactivos se pueden utilizar solos o en combinaciones de dos o más de ellos.

El compuesto de la presente invención puede aplicarse en un estado mezclado con otro herbicida, diversos insecticidas, un bactericida, un regulador de crecimiento de plantas, un agente sinérgico, o similares en el momento de la formulación o aplicación de herbicidas.

En particular, mediante la aplicación del herbicida en un estado mixto con otro herbicida, se puede esperar la reducción en el costo por la reducción en una cantidad de aplicación, la expansión en el espectro herbicida por acción sinérgica de herbicidas mixtos, y un efecto herbicida más alto. En este momento, una combinación de una pluralidad de herbicidas conocidos, al mismo tiempo también es posible.

Ejemplos del herbicida preferible utilizado en una mezcla con el compuesto de la presente invención pueden incluir acetoclor / nombre general, acifluorfen / nombre general, aclonifen / nombre general, alaclor / nombre general, aloxidim / nombre general, aloxidim de sodio / nombre general, ametrina / nombre general, amicarbazona / nombre general, amidosulfurón / nombre general, aminociclopiraclor / nombre general, sales y ésteres de aminociclopiraclor, aminopiralid / nombre general, sales y ésteres de aminopiralid, amiprophos-metil / nombre general, amitrol / nombre general, anilofos / nombre general, asulam / nombre general, atrazina / nombre general, azafenidina / nombre general, azimsulfurón / nombre general, beflubutamida / nombre general, benazolin-etil / nombre general, bencarbazona / nombre general, benfluralina (benefina) / nombre general, benfuresato / nombre general, bensulfurón-metil / nombre general, bensulida / nombre general, bentazona / nombre general, bentazona en sodio / nombre general, sales de Bentazona, bentiocarb / nombre general, benzfendizona / nombre general, benzobiciclon / nombre general, benzofenap / nombre general, biciclopirona / nombre general, bifenox / nombre general, bispiribac / nombre general, / nombre general, bispiribac de sodio, bromacil / nombre general, bromobutida / nombre general, bromofenoxim / nombre genérico, bialafos / nombre general, bialafos-sodio, bromoxinil / nombre general, bromoxinil-sales y ésteres, butaclor / nombre general, butafenacil / nombre general, butamifos / nombre general, butenaclor / nombre general, butralina / nombre general, butroxidim / nombre general, butilato / nombre general, cafenstrol / nombre general, carbetamida / nombre general, etilcarfentrazona /no, clometoxifeno / nombre general, chlomethoxynil / nombre general, cloramben / nombre general, cloramben-sales y ésteres, chloransulam-metil / nombre general, clorflurenol-metil / nombre general, cloridazon / nombre general , clorimurón-etil / nombre general, chlorobromuron / nombre general, clorotoluron nombre / nombre general, cloroxurón / nombre general, clorftalim / nombre general, Clorprofam / nombre general, Clorpropham / nombre general, clorosulfurona / nombre general, clortal-dimetil / nombre general, clortiamid / nombre general, cinidón-etilo / nombre general, cinmetilina / nombre general, cinosulfurón / nombre general, cletodim / nombre general, clodinafop / nombre general,

clodinafop-propargilo / nombre general, clomazona / nombre general, clomeprop / nombre general, clopiralid / nombre general, clopiralid-sales y ésteres, / nombre general CNP, cumilurón / nombre general, cyanazin / nombre general, cicloato / nombre general, / nombre general cyclopyrimorate (SW-065 / nombre de la prueba), ciclosulfamurón / nombre general, cicloxidim / nombre general, cihalofopbutilo / nombre general, DAH-500 / nombre de la prueba, dalapon / nombre general, dazomet / nombre general, desmedifam / nombre general, desmetrina / nombre general, dicamba / nombre general, dicamba-sales y ésteres, diclobenil / nombre, diclofop / nombre general en general, diclofop-metil / nombre general, diclorprop / nombre general, diclorprop-sales y ésteres, diclorprop-P / nombre general, sales y ésteres de diclorprop-P-, diclosulam / nombre general, difenzoquat / nombre general , diflufenican / nombre general, diflufenzopir / nombre general, diflufenzopir de sodio / nombre general, dimepiperato / nombre general, dimetametrina / nombre general, dimetaclor / nombre general, dimetenamid / nombre general, dimetenamida-p / nombre general, dimetipin / nombre general, dinitramina / nombre general, dinoseb / nombre general, dinoterb / nombre general, DNOC / nombre general , difenamida / nombre general, diquqt / nombre general, ditiopil / nombre general, diurón / nombre general, DSMA / nombre general, dymron / nombre general, endotal / nombre general, EPTC / nombre general, esprocarb / nombre general, etalfluralina / nombre general, etametsulfurón-metilo / nombre general, etofumesato / nombre general, etobenzanid / nombre general, etoxisulfurón / nombre general, flazasulfurón / nombre general, fenoxaprop / nombre general, fenoxaprop-etilo / nombre general, fenoxasulfona / nombre general, fenquionotrion / nombre general, fentrazamida / nombre general, flamprop / nombre general, flazasulfurón / nombre general, florasulam / nombre general, fluazifop / nombre general, fluazifop-butilo / nombre general, flucetosulfurón / nombre general, flucloralin / nombre general, flufenacet / nombre general, flufenpil-etil / nombre general, flumetsulam / nombre general, fluazolato / nombre general, flucarbazona de sodio /nombre general, flumiclorac-pentilo / nombre general, flumioxacina / nombre general, fluometurón / nombre general, Fluoroglicofen etilo /nombre general, flupirsulfurón / nombre general, flupoxam / nombre general, Flurenol / nombre general, fluridona / nombre general, flurocloridona / nombre general, fluroxipir / nombre general, ésteres de fluroxipir, flurprimidol / nombre general, flurtamona / nombre general, flutiacet-metil / nombre general, fomesafen / nombre general, foramsulfurón / nombre general, fosamina / nombre general, glufosinato / nombre general, glufosinato de amonio / nombre general, glifosato / nombre general, glifosato de amonio / nombre general, glifosato-iso-propilamonio / nombre general,

glifosato de potasio / nombre general, glifosato de sodio / nombre general, glifosato trimesio / nombre general, halauxifen / nombre general, sales y ésteres de halauxifen, halosafeno / nombre general, halosulfurón / nombre general, halosulfurón-metil / nombre general, haloxifop / nombre general, haloxifop-metilo / nombre general, hexazinona / nombre general, imazametabenz-metilo / nombre general, imazamox / nombre general, imazapic / nombre general, imazapir / nombre general , imazetapir / nombre general, imazaquin / nombre general, imazosulfurón / nombre general, indanofan / nombre general, indaziflam / nombre general, yodosulfurón-metilo de sodio / nombre general, ioxinil octanoato / nombre general, sales y ésteres de ioxinil, ipfencarbazona / nombre general, isoproturón / nombre general, isouron / nombre general, isoxaben / nombre general, isoxaflutol / nombre general, carbutilato / nombre general, lactofen / nombre general, lenacilo / nombre general, linurón / nombre general, hidracida maléico / nombre general, MCPA / nombre general, sales y ésteres de MCPA, MCPB / nombre general, sales y ésteres de MCPB-, mecoprop (MCPP) / nombre general, sales y ésteres de mecoprop, mecoprop-P (MCPP-P) / nombre general, sales y ésteres de mecoprop-P, mefenacet / nombre general, mefluidida / nombre general, mesosulfurón-metil / nombre general, mesotriona / nombre general, metam / nombre general, metamifop / nombre general, metamitrona / nombre general, metazaclor / nombre general, metabenztiazurón / nombre general, metazosulfuron / nombre general, methiozolin / nombre general, azida de metilo / nombre general, bromuro de metilo / nombre general, metilo dymron / nombre general, yoduro de metilo / nombre general, metobenzuron / nombre general, metolacloro / nombre general, metolacloro-S / nombre general, metosulam / nombre general, metribuzina / nombre general, metsulfurón-metil / nombre general, metoxurón / nombre general, molinato / nombre general, monolinurón / nombre, monosulfuron / nombre general, monosulfuron-metil / nombre general, MSMA / nombre general, naproanilida / nombre general, napropamida / nombre general, naptalam / nombre general, naptalam de sodio / nombre general, neburón / nombre general, nicosulfurón / nombre general, norflurazon / nombre general, OK-701 / nombre general, ácido oleico / nombre general , orbencarb / nombre general, orthosulfamuron / nombre general, orizalina / nombre general, oxadiargilo / nombre general, oxadiazón / nombre general, oxasulfurón / nombre, oxaziclomefona / nombre general, oxifluorfeno / nombre general, paraquat / nombre general, pelargonicacid / nombre general, pendimetalina / nombre, penoxsulam / nombre general general, pentanoclor / nombre general, pentoxazona / nombre general, petoxamida/ nombre general , fenmedifam-etil / nombre general, picloram / nombre general, sales y ésteres de Picloram,

picolinafeno / nombre general, pinoxaden / nombre general, piperofos / nombre general, pretilaclor / nombre general, primisulfuron-metil / nombre general, prodiamina / nombre general, profluazol / nombre general, profoxidim / nombre general, prometón / nombre general, prometrina / nombre general, propaclor / nombre general , propanil / nombre general, propaquizafop / nombre general, propazin / nombre general, profam / nombre general, propisocloro / nombre general, propoxicarbazona de sodio / nombre general, propirisulfuron / nombre general, propizamida / nombre general, prosulfocarb / nombre general, prosulfurón / nombre general, piraclonil / nombre general, piraflufenetilo / nombre general, pirasulfotol / nombre general, pirazolinato / nombre general, pirazosulfurón / nombre general, pirazosulfurón-etil / nombre general, pirazoxifeno / nombre general, piribenzoxim / nombre general, piributicarb / nombre general, piridafol / nombre general, piridato / nombre general, piriftalid / nombre general, piriminobac-metil / nombre general, pirimisulfan / nombre general, piritiobac de sodio / nombre general, piroxasulfona / nombre general, piroxsulam / nombre general, quinclorac / nombre general, quinmerac / nombre general, quinoclamina / nombre general, quizalofop / nombre general, quizalofop-etilo / nombre general, quizalofop-tefurilo / nombre general, quizalofop-P / nombre general, quizalofop-P-etilo / nombre general, quizalofop-P- tefurilo / nombre general, rimsulfurona / nombre general, Saflufenacil / nombre general, setoxidim / nombre general, siduron / nombre general, simazina / nombre general, simetrina / nombre general, SL-261 / nombre general, sulcotriona / nombre general, sulfentrazona / nombre general, sulfometuron-metil / nombre general, sulfosulfuron / nombre general, TCBA (2,3,6-TBA) / nombre general, sales y ésteres de 2,3,6-TBA, TCTP (clortal-dimetil, tetoraclorotiofeno) / nombre general, tebutam / nombre general, tebutiurón / nombre general, tefuriltriona / nombre general, tembotriona / nombre general, tepraloxidim / nombre general, terbacilo / nombre general, terbumeton / nombre general, terbutilazina / nombre general, terbutrina / nombre general, tetrapion (flupropanato) / nombre general, tenilcloro / nombre general, tiazafluron / nombre general, tiazopir / nombre general / nombre general, tidiazurón / nombre general, tiencarbazona-metil / nombre general, / nombre general, tolpiralato / nombre general, topramezon tifensulfurón-metil / nombre general, tralcoxidim / nombre general, triafamone / nombre general, trialato / nombre general, triasulfurón / nombre general, triaziflam / nombre general, tribenurón-metil / nombre general, triclopir / nombre general, sales y ésteres de triclopir-, tridifano / nombre general, trietazina / nombre general, trifludimoxadin / nombre general, trifloxisulfurón / nombre general, trifluralina / nombre general, triflusulfurón-metil / nombre

general, tritosulfurón / nombre general, 2,4-PA / nombre general, sales y ésteres de 2,4-PA-, 2,4-DB / nombre general y sales y ésteres de 2,4-DB. Estos componentes se pueden utilizar solos o en combinaciones de dos o más de ellos. Cuando estos componentes se mezclan, la proporción de mezcla puede ser libremente seleccionada.

Los ejemplos de agentes de seguridad pueden incluir AD-67, benoxacor / nombre general, cloquintocet-mexilo / nombre general, ciomerinil / nombre general, diclormid / nombre general, diciclonona / nombre general, ciprosulfamida / nombre general, dietorato / nombre general, CAD -24, dimron / nombre general, fenclorazol-etil / nombre general, fenclorim / nombre general, HEXIM / nombre general, flurazol / nombre general, fluxofenim / nombre general, furilazol / nombre general, isoxadifen / nombre general, etil isoxadifen / nombre general, MCPA, mecoprop / nombre general, mefenpir / nombre general, mefenpir-etil / nombre general, mefenpir-dietil / nombre general, mefenato / nombre general, MG-191, NA (naftálico anhídrido), OM (octametileno-diamina), oxabetrinil / nombre general, PPG-1292, y R-29148. Estos componentes activos quimicos agricolas se pueden utilizar solos o en combinaciones de dos o más de ellos. Cuando estos componentes se mezclan, la proporción de mezcla puede ser libremente seleccionada.

Aunque la cantidad de aplicación del compuesto de la presente invención varía dependiendo de la situación de aplicación, el tiempo de aplicación, el método de aplicación, la cosecha cultivada y similares, la cantidad de aplicación apropiada es generalmente 0,005 kg/ha a 50 kg/ha como la cantidad de componente activo.

A continuación, se describirán los ejemplos de formulación de las formulaciones herbicidas cuando se utiliza el compuesto de la presente invención. Sin embargo, los ejemplos de formulación de la presente invención no se limitan a estos ejemplos. En lo sucesivo, el término "parte" en los ejemplos de formulación se refiere a parte por peso.

Agentes dispersables en agua

Compuesto de la presente invención	0,1 partes a 80 partes
Vehículo sólido	5 partes a 98.9 partes
Tensioactivo	1 parte a 10 partes
Otros	0 partes a 5 partes

Ejemplos de otros pueden incluir agentes antiaglomerantes, agentes estabilizantes y similares.

Agente de Emulsión

Compuesto de la presente invención	0,1 partes a 30 partes
Vehículo líquido	45 partes a 95 partes
Tensioactivo	4,9 partes a 15 partes
Otros	0 partes a 10 partes

Ejemplos de otros pueden incluir agentes de dispersión, agentes estabilizantes y similares.

Agente de flujo

Compuesto de la presente invención	0,1 partes a 70 partes
Vehículo líquido	15 partes a 98,89 partes
Tensioactivo	1 parte a 12 partes
Otros	0,01 partes a 30 partes

Ejemplos de otros pueden incluir agentes anticongelantes, espesantes y similares.

Agente de flujo seco

Compuesto de la presente invención	0,1 partes a 90 partes
Vehículo sólido	0 partes a 98.9 partes
Tensioactivo	1 parte a 20 partes
Otros	0 partes a 10 partes

Ejemplos de otros pueden incluir aglutinantes, agentes estabilizantes y similares.

Agente líquido

Compuesto de la presente invención	0,01 partes a 70 partes
Vehículo líquido	20 partes a 99,99 partes
Otros	0 partes a 10 partes

Ejemplos de otros pueden incluir agentes anticongelantes, agentes de dispersión y similares.

Agente formador de gránulos

Compuesto de la presente invención	0,01 partes a 80 partes
Vehículo sólido	10 partes a 99.99 partes
Otros	0 partes a 10 partes

Ejemplos de otros pueden incluir aglutinantes, agentes estabilizantes y similares.

Agente en polvo

Compuesto de la presente invención	0,01 partes a 30 partes
Vehículo sólido	65 partes a 99.99 partes
Otros	0 partes a 10 partes

Ejemplos de Otros pueden incluir agentes antideslizantes, agentes estabilizantes y similares.

Cuando se utilizan los agentes, la formulación herbicida se aplica sin ningún tratamiento o al diluir el agente de 1 a 10.000 veces con agua.

Ejemplo de formulación herbicida

A continuación, se describirán ejemplos de formulación química agrícola que contienen el compuesto de la presente invención como el componente activo. La presente invención, sin embargo, no se limita a estos ejemplos. En lo sucesivo, el término "parte" en los ejemplos de formulación se refiere a parte por peso.

[Ejemplo de la Formulación 1] agente dispersable en agua

Compuesto de la presente invención	No. 1-001	20 partes
Pirofilita		76 partes
Sorpol 5039		2 partes
(Tensioactivo aniónico: fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd., nombre comercial)		
CARPLEX #80		2 partes
(Ácido silícico hidratado sintético: Shionogi & Co., Ltd., nombre comercial)		

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se pulverizan para proporcionar el agente dispersable en agua.

[Ejemplo de la Formulación 2] agente de emulsión

Compuesto de la presente invención	No. 1-001	5 partes
Xileno		75 partes
N-metilpirrolidona		15 partes
Sorpol 2680		5 partes
(Tensioactivo aniónico: fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd., nombre comercial)		

Los componentes anteriores se mezclan para proporcionar el agente de emulsión.

[Ejemplo de la Formulación 3] Agente de flujo

Compuesto de la presente invención	No. 1-001	25 partes
Agrisol S-710		10 partes
(El tensioactivo no iónico: Kao Corporation, nombre comercial)		
Lunox 1000C		0.5 partes
(Tensioactivo aniónico: fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd., nombre comercial)		
Goma xantano		0,02 partes

Agua 64,48 partes

Después de que los componentes anteriores se mezclan uniformemente, la mezcla se pulveriza en humedo para proporcionar el agente de fluidez.

[Ejemplo de la Formulación 4] Agente de flujo seco

Compuesto de la presente invención No. 1-001 75 partes

HITENOL NE-15 5 partes

(Tensioactivo aniónico: fabricado por DKS Co., Ltd., nombre comercial)

Vanillex N 10 partes

(Tensioactivo aniónico: Fabricado por NIPPON PAPER INDUSTRIES Co., LTD, nombre comercial)

CARPLEX #80 10 partes

(Ácido silícico hidratado sintético: Shionogi & Co., Ltd., nombre comercial)

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se pulverizan y después se añadió una pequeña cantidad de agua a la mezcla para agitar, mezclar, y amasar. La mezcla resultante se granula con un granulador de extrusión. Los gránulos se secaron para formar el agente de flujo seco.

[Ejemplo de Formulación 5] agente granular

Compuesto de la presente invención No. 1-001 1 parte

Bentonita 55 partes

Talco 44 partes

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se pulverizan y después se añadió una pequeña cantidad de agua a la mezcla para agitar, mezclar, y amasar. La mezcla resultante se granula con un granulador de extrusión. Los gránulos se secaron para proporcionar el agente granular.

Ejemplos

En lo sucesivo, la presente invención se describirá adicionalmente en detalle mediante la descripción específica de los Ejemplos de síntesis y Ejemplos de Ensayo de los compuestos de amidas heterocíclicas de Fórmula (1) en la presente invención como Ejemplos. La presente invención, sin embargo, no se limita a estos ejemplos.

Como una cromatografía líquida preparativa a presión media descrita en los Ejemplos de Síntesis y Ejemplos de Referencia, aparatos preparativos de presión media; YFLC-Wprep (tasa de

flujo: 18 ml/min, columna rellenada de gel de sílice 40 μm) fabricado por Yamazen Corporation.

Los valores de los desplazamientos químicos de resonancia magnética nuclear de protón en los Ejemplos se midieron a 300 MHz utilizando Me_4Si (tetrametilsilano) como una sustancia de referencia. Los disolventes utilizados en la medición se describen en los siguientes Ejemplos de síntesis. Los símbolos de los valores de desplazamiento químico de la resonancia magnética nuclear de protón en los Ejemplos tienen los siguientes significados.

S: singulete, d: doblete, t: triplete, m: multiplete, q: cuarteto y br: Ancho

Ejemplo de Síntesis

[Ejemplo de Síntesis 1]

3-isopropil-5-metil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida (Compuesto No. 1-003)

Paso 1; Síntesis de 2-hidrazinil-6-metilnicotinato de metilo

A la solución mixta de 3.0 g (16.2 mmol) de 2-cloro-6-metilnicotinato de metilo y 30 ml de dioxano, se añadió 1.62 g (32.3 mmol) de monohidrato de hidrazina a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó a 60° C durante 4 horas y posteriormente 80°C durante 6 horas. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (150 ml, 2 vez). La fase orgánica obtenida se lavó con una solución acuosa saturada de bicarbonato sódico. A partir de entonces, la fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con hexano y se filtró para proporcionar 1.60 g del producto diana como un sólido de color naranja.

Punto de fusión: 90°C a 91°C

Paso 2; Síntesis de 2-(2-isobutirilhidrazinil)-6-metilnicotinato de metilo

A la solución mixta de 1.5 g (8.28 mmol) de 2-hidrazinil-6-metilnicotinato de metilo, 838 mg (8.28 mmol) de trietilamina, y 20 ml de tetrahidrofurano, se añadió 882 mg (8.28 mmol) de cloruro de isobutirilo bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 30 minutos bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (100 ml, 1 vez). La fase orgánica obtenida se lavó con salmuera. A partir de entonces, la fase

orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con hexano y éter diisopropílico se filtró para proporcionar 1.68 g del producto diana como un sólido color carne.

Punto de fusión: 99°C a 101°C

Paso 3; Síntesis de 3-isopropil-5-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

A la solución mixta de 1.6 g (63.7 mmol) de 2-(2-isobutirilhidrazinil)-6-metilnicotinato de metilo y 10 ml de tolueno, 3 ml de cloruro de fosforilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 5 horas con calentamiento a reflujo. Después de terminar la agitación, la mezcla de reacción se añadió a agua helada para terminar la reacción. A partir de entonces, el líquido de reacción se lavó con acetato de etilo (50 ml, 1 vez). A la fase acuosa obtenida, se añadió carbonato de potasio bajo enfriamiento con hielo para ajustar el pH de 8 a 9. Por lo tanto, el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (100 ml, 2 vez). La fase orgánica obtenida se secó sobre sulfato de sodio y el solvente se separo por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 490 mg del producto deseado como un sólido amarillo claro.

Punto de fusión: 138°C a 140°C

Paso 4; Síntesis del ácido 3-isopropil-5-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

A la solución mixta de 450 mg (1.93 mmol) de 3-isopropil-5-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo y 4 ml de metanol, 2 ml de solución acuosa de hidroxido de sodio 1 M se añadió a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 2 horas a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, se añadió ácido clorhídrico 1 M para ajustar el pH a entre 2 y 3. Después de que el solvente en el líquido de reacción se separó por destilación bajo presión reducida, el sólido precipitado se lavó con agua y se filtró para proporcionar 250 mg del producto deseado como un sólido amarillo claro.

Punto de fusión: 194°C a 195°C

Paso 5; Síntesis de 3-isopropil-5-metil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida

A la solución mixta de 400 mg (1.95 mmol) del ácido 3-isopropil-5-metil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico, 0.1 ml de N,N-dimetilformamida, y 3 ml de cloruro de metileno, se añadió 463 mg (3.91 mmol) de cloruro de oxalilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición,

la mezcla de reacción se agitó durante 1 horas a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, el solvente en la mezcla de reacción se separó por destilación bajo presión reducida para proporcionar clorhidrato de cloruro del ácido 3-isopropil-5-metil-[4,3-a]triazolo[1,2,4]piridina-8-carboxílico crudo. A la solución mixta de 540 mg (1.95 mmol) clorhidrato de cloruro del ácido3-isopropil-5-metil- [1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico crudo obtenido, 180 mg (1.82 mmol) de 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-amina y 5 ml de cloruro de metileno, se añadió 368 mg (3.91 mmol) de trietilamina bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 20 horas a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, se añadió 5 ml de piridina y 10 mg de 4- (dimetilamino)piridina a la mezcla de reacción. A partir de entonces, La mezcla de reacción resultante se agitó a 68º C durante 10 horas. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (20 ml, 1 vez). La fase orgánica obtenida se lavó con salmuera. A partir de entonces, la fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de sodio anhidro y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y scetato de etilo y se filtró para proporcionar 60 mg del producto diana como un sólido de color marrón.

[Ejemplo de Síntesis 2]

3-isopropil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida (Compuesto No.1-004)

A la solución mixta de 160 mg (0.59 mmol) del ácido 3-isopropil-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico, 70 mg (0.71 mmol) de 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-amina, y 5 ml de N,N-dimetilformamida, 135 mg (0.71 mmol) de hidrocloruro de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida y se añadió 96 mg (0.71 mmol) de 1-hidroxi-7-azabenzotriazol. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 24 horas a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el líquido de reacción se extrajo con cloroformo (100 ml, 1 vez). La fase orgánica obtenida se lavó con salmuera. A partir de entonces, la fase orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en gel de sílice {n-hexano: acetato de etilo = 1:1 a 0:1 (proporción de volumen; lo mismo se aplica en lo sucesivo)} para proporcionar 90 mg del producto deseado como un sólido blanco.

Punto de fusión: 176°C a 178°C

[Ejemplo de Síntesis 3]

3-isopropil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(metiltio)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida (Compuesto No.1-009)

Paso 1; Síntesis de 2-hidrazinilo-6-cloronicotinato de metilo

A la solución mixta de 11.5 g (55.8 mmol) de 2,6-dicloronicotinato de metilo y 150 ml de dioxano, se añadió 5.58 g (111 mmol) de monohidrato de hidrazina a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 18 horas a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el solvente en el líquido de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con agua y se filtró para proporcionar 10.7 g del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 82 °C a 83 °C

Paso 2; Síntesis de 2-(2-isobutirilhidrazinil)-6-cloronicotinato de metilo

A la solución mixta de 5.0 g (24.8 mmol) de 2-hidrazinilo-6-cloronicotinato de metilo, 2.5 g (24.8 mmol) de trietilamina, y 20 ml de tetrahidrofurano, se añadió 2.64 g (24.8 mmol) de cloruro de isobutirilo bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 2 horas bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (150 ml, 1 vez). La fase orgánica obtenida se lavó con salmuera. A partir de entonces, la fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y hexano y se filtró para proporcionar 5.90 mg del producto diana como un sólido de color blanco.

Punto de fusión: 147 °C a 148 °C

Paso 3; Síntesis de 3-isopropil-5-cloro-[1,2,4]triazolo [4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

5.9 g (21.7 mmol) de 2- (2-isobutirilhidrazinil)-6-cloronicotinato y 20 ml de cloruro de fosforilo se mezclaron a temperatura ambiente y a partir de entonces la mezcla de reacción se agitó durante 5 horas con calentamiento a reflujo. Después de terminar la agitación, la mezcla de reacción se añadió a agua helada para terminar la reacción. Por lo tanto, el líquido de reacción se lavó con acetato de etilo (50 ml, 1 vez). Se añadió carbonato de potasio a la fase acuosa obtenida

bajo enfriamiento con hielo para ajustar el pH entre 8 y 9 y el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (200 ml, 2 veces). La fase orgánica obtenida se secó sobre sulfato de sodio y el solvente se separo por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 4.75 g del producto diana como un sólido amarillo claro.

Punto de fusión: 105°C a 107°C

Paso 4; Síntesis de 3-isopropil-5-(metiltio)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

A la solución mixta de 420 mg (1.66 mmol) de 3-isopropil-5-cloro-[1,2,4]triazolo [4,3-a] piridina-8-carboxilato de metilo y 3 ml de N,N-dimetilformamida , se añadió 140 mg (1.99 mmoles) de tiometóxido de sodio bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 45 horas bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (30 ml, 3 vez). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego con sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 280 mg del producto diana como un sólido amarillo claro.

Punto de fusión: 142°C a 145°C

Paso 5; Síntesis de 3-isopropil-5-metil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(metiltio)-[1,2,4]riazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida

A la solución mixta de 140 mg (0.53 mmol) de 3-isopropil-5-(metiltio)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo, 3 ml de metanol, y 1 ml de agua se añadió 0.6 ml de solución acuosa de hidroxido de sodio 1 M a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 17 horas a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de 1 ml de ácido clorhídrico 1 M. El solvente en la mezcla de reacción se separó por destilación bajo presión reducida para proporcionar clorhidrato de cloruro del ácido 3-isopropil-5-(metiltio)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico crudo. A la solución mixta de 190 mg (0.53 mmol) ácido3-isopropil-5-(metiltio)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico crudo obtenido, 104 mg (1.06 mmol) de 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-amina y 3ml de piridina, se añadió 126 mg (1.06 mmol) de cloruro de tionilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó a 60° C durante 5 horas. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de

agua y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y cloroformo y se filtró para proporcionar 5.90 mg del producto diana como un sólido color ocre.

[Ejemplo de Síntesis 4]

3-cloro-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida (Compuesto No. 1-013)

Paso 1; Síntesis del àcido 3-cloro-5- (trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

A la solución mixta de 300 mg (1.30 mmol) del àcido 5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo [4,3-a]piridina-8-carboxílico y 6 ml de N,N-dimetilformamida, se añadió 347 mg (2.60 mmol) de N-clorosuccinimida a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó a 60° C durante 4 horas. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (50 ml, 2 vez). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego con sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 210 mg del producto diana como un sólido amarillo claro.

Paso 2; Síntesis de 3-chloro-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[l,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida

A la solución mixta de 70 mg (0.26 mmol) del àcido 3-cloro-5- (trifluorometil)-[1,2,4]triazolo [4,3-a]piridina-8-carboxílico, 52 mg (0.53 mmol) de 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-amina, 10 mg (0.03 mmol) de 4-(dimetilamino)piridina y 5 ml de piridina, se añadió 63 mg (0.53 mmol) de cloruro de tionilo a temperatura ambiente . La mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el líquido de reacción se extrajo con cloroformo (15 ml, 3 vez). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego con sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 52 mg del producto deseado como un sólido amarillo claro.

Punto de fusión: 238°C a 241°C

[Ejemplo de Síntesis 5]

3-isopropil-N-(4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida (Compuesto No. 3-001)

A la solución mixta de 165 mg (0.60 mmol) del ácido 3-isopropil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico, 0.1 ml de N,N-dimetilformamida, y 5 ml de cloruro de metileno, se añadió 83 mg (0.66 mmol) de cloruro de oxalilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 20 horas a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, se añadió la solución mixta de 119 mg (1.21 mmol) de 4-metil-1,2,5-oxadiazol-3-amina, 122 mg (1.21 mmol) de trietilamina y 3 ml de cloruro de metileno. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. Después terminar la agitación, el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en gel de sílice (n-hexano: acetato de etilo = 9:1 a 2:1 para proporcionar 168 mg del producto diana como un sólido blanco.
Punto de fusión: 185°C a 186°C

[Ejemplo de Síntesis 6]

5-cloro-3-isopropil-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-[1,2,4] triazolo [4,3-a] piridina-8-carboxamida (Compuesto No. 2-004)

A la solución mixta de 500 mg (1.97 mmol) de 5-cloro-3-isopropil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo, 3 ml de metanol, y 1 ml de agua se añadió 2 ml de solución acuosa de hidroxido de sodio 1 M bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de 2,5 ml de ácido clorhídrico 1 M. El solvente en el liquido de reacción se separó por destilación bajo presión reducida para proporcionar àcido 5-cloro-3-isopropil-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxìlico crudo. A la solución mixta de 500 mg (1.97 mmol) del àcido 5-cloro-3-isopropil- [1,2,4]triazolo [4,3-a]piridina-8-carboxílico, 390 mg (3.94 mmol) de 1-metil-1H-tetrazol-5-amina, 24 mg (0.19 mmol) de 4-(dimetilamino)piridina y 5 ml de piridina, se añadió 469 mg (3.94 mmol) de cloruro de tionilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 2 dias a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, la reacción se terminó mediante la adición de agua y el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (50 ml, 2 vez). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego con sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El

residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en gel de sílice (n-hexano: acetato de etilo = 4:1 a 1:1) para proporcionar 140 mg del producto diana como un sólido amarillo claro.

Punto de fusión: 189°C a 190°C

[Ejemplo de Síntesis 7]

3-(metoximetil)-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida (Compuesto No. 2-010)

Paso 1; Síntesis de 2-(2-(2-metoxiacetil) hidrazinilo)-6-(trifluorometil)nicotinato de metilo (Compuesto No. A1-05a)

A la solución mixta de 1.0 g (4.25 mmol) de 2-hidrazinil-6-(trifluorometil)nicotinato, 473 mg (4.68 mmol) de trietilamina, y 20 ml de solución de tetrahidrofurano, se añadió 508 mg (4.68 mmol) de cloruro de metoxiacetilo bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 30 minutos bajo enfriamiento con hielo. Después terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. Después se añadieron 15 ml de agua, la mezcla se extrajo con cloroformo (30 ml, 1 vez y 10 ml, 2 veces). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego con sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 1.16 g del producto diana como un sólido blanco.

Punto de fusión: 76°C a 77°C

Paso 2; Síntesis de 3-(metoximetil)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a] piridina-8-carboxilato de metilo (Compuesto No. B1-05a)

A la solución mixta de 1.16 g (3.78 mmol) de 2-(2-(2-metoxiacetil)hidrazinil)-6-(trifluorometil)nicotinato y 17 ml de tolueno, se añadió +1.74 g (11.3 mmol) de cloruro de fosforilo a temperatura ambiente. Después de determinar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 5 horas con calentamiento a reflujo. Después de terminar la reacción, la solución de reacción se vertió en 20 ml de agua preparados por separado. Se añadió una solución acuosa de hidrogenocarbonato para ajustar el pH entre 8 y 9 y a partir de entonces la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (30 ml, 1 vez y 15 ml, 3 veces). La fase orgánica combinada se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego con sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 721 mg del producto

deseado como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 95°C a 97°C

Paso 3; Síntesis del ácido 3- (metoximetil)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico (Compuesto No. C1-05)

A la solución mixta de 693 mg (2.39 mmol) de 3-(metoximetil)-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo y 7 ml de etanol, se añadieron 7 ml de solución acuosa de 115 mg (2.87 mmol) de hidróxido de sodio bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 30 minutos bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la agitación, se añadió ácido clorhídrico 1 M para ajustar el pH entre 2 y 3. A partir de entonces, la mezcla resultante se extrajo con cloroformo (30 ml, 1 vez y 15 ml, 3 veces). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 553 mg del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 111°C a 112°C

Etapa 4; Síntesis de3-(metoximetil)-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida

A la solución mixta de 100 mg (0.36 mmol) del àcido 3-(metoximetil)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico, 72 mg (0.73 mmol) de 1-metil-1H-tetrazol-5-amina, 5 mg (0.03 mmol) de 4-dimetilaminopiridina y 2 ml de piridina, se añadió 87 mg (0.73 mmol) de cloruro de tionilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. Después terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. Al residuo obtenido, se añadió ácido clorhídrico 1 mol/L para ajustar el pH entre 2 y 3. A partir de entonces, la mezcla resultante se extrajo con cloroformo (15 ml, 3 veces). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 76 mg del producto diana como un sólido blanco.

Punto de fusión: 205°C a 209°C

[Ejemplo de Síntesis 8]

N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(metiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-

a]piridina-8-carboxamida (Compuesto No. 1-018)

Paso 1; Síntesis de 3-tioxo-5-(trifluorometil)-2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a] piridina-8-carboxilato de metilo

La solución mixta de 1.0 g (4.25 mmol) de 2-hidrazinilo-6-(trifluorometil)nicotinato de metilo, 795 mg (4.46 mmol) de 1,1'-tiocarbonildiimidazol, y se agitó10 ml de N, N-dimetilformamida a 60 ° C durante 3 horas. Después terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 534 mg de la mezcla del producto diana y imidazol como un sólido rojo.

Paso 2; Síntesis de 3-(metiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

A 10 ml de solución de N, N-dimetilformamida de 534 mg de 3-tioxo-5-(trifluorometil) -2,3-dihidro-[1,2,4]triazolo[4,3-a] piridina-8- carboxilato de metilo obtenido en la Etapa 1 que contiene imidazol, se añadió 402 mg de yoduro de metilo a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 1.5 horas. Después terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. Se añadió 15 ml de agua al residuo obtenido y la mezcla resultante se extrajo con cloroformo (15 ml, 3 veces). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 336 mg del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 163°C a 167°C

Paso 3; Síntesis del ácido 3-(metiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico

A la solución mixta de 332 mg (1.14 mmol) de 3-(metiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo y 3 ml de metanol, se añadió 2.8 ml (1.4 mmol) de 0.5 mol/L solución acuosa de hidróxido bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 1hora bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la reacción, se añadió 1 mol/L de ácido clorhídrico a la solución de reacción para ajustar el pH entre 2 y 3. El sólido precipitado se lavó con 1 mol/L de ácido clorhídrico, agua y eter diisopropilico y se filtró para proporcionar 228 mg del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 158°C a 162°C

Paso 4; Síntesis de N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(metiltio)-5-(trifluorometil)-[l,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida

A la solución mixta de 100 mg (0.36 mmol) del àcido 3-(metiltio)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico, 71 mg (0.72 mmol) de 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-amina, 4 mg de 4-dimetilaminopiridina, y 2 ml de piridina, se añadió 129 mg (1.08 mmol) de cloruro tionilo bajo enfriamento con hielo. Después de terminar la adición, la solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 20 minutos. Después terminar la reacción, el solvente en la solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida. Al residuo obtenido, se añadió ácido clorhídrico 1 mol/L para ajustar el pH entre 2 y 3. A partir de entonces, la mezcla resultante se extrajo con cloroformo (15 ml, 3 veces). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El sólido precipitado se lavó con éter diisopropílico y se filtró para proporcionar 100 mg del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 230°C a 233°C

[Ejemplo de Síntesis 9]

3-iIsopropil-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carbotioamida (Compuesto No. 2-039)

La solución mixta de 100 mg (0.28 mmol) de 3-isopropil-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida,114 mg (0.28 mmol) de reactivo de Lawesson [2,4-bis (4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiadifosfetano-2,4-disulfuro], y se agitó 3 ml de tolueno a 110 ° C durante 5 horas. Después de terminar la agitación, se añadió 114 mg (0.28 mmol) de reactivo de Lawesson a la solución de reacción y la solución resultante se agitó adicionalmente a 110 ° C durante 3 horas. Después de terminar la reacción, se añadió 5 ml de ácido clorhídrico 0.1 N a la solución de reacción y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (15 ml, 1 vez). La fase orgánica se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El residuo obtenido se purificó con la cromatografía líquida preparativa de presión media eluyendo el residuo con acetato de n-hexano (gradiente de 4: 1 a 3: 7) para proporcionar 66 mg del producto diana como un sólido amarillo.

Punto de fusión: 198°C a 200°C

[Ejemplo de Síntesis 10]

3-Alil-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida y N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida (compuesto No. 1-159 y compuesto No. 1-159 *)

Paso 1; Síntesis de 3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo y 3- (prop-1-en-1-il) -5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo

A la solución mixta de 1.20 g (3.96 mmol) de 2-(2-(but-3-enoil)hidrazinil)-6-(trifluorometil)nicotinato de metilo sintetizado en un método similar a la Etapa 1 en el Ejemplo de síntesis 7 y 18 ml de tolueno, se añadió 1.82 g (11.9 mmol) de cloruro de fosforilo a temperatura ambiente. Después de determinar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 5 horas con calentamiento a reflujo. Después de terminar la reacción, la solución de reacción se vertió en 20 ml de agua preparados por separado. Se añadió una solución acuosa de hidrogenocarbonato para ajustar el pH entre 8 y 9 y a partir de entonces la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (30 ml, 1 vez y 15 ml, 3 veces). La fase orgánica combinada se deshidrató y se secó con solución acuosa saturada de cloruro sódico y luego con sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó por destilación bajo presión reducida. El residuo obtenido se purificó con cromatografía líquida preparativa de presión media eluyendo el residuo con acetato de n-hexano-etilo (gradiente de 7:3 a 0:1) para proporcionar 730 mg del producto diana como un sólido blanco [3-alil-5-(trifluorometil) - [1,2,4] triazolo [4,3-a] piridina-8-carboxilato de metilo/ 3- (prop-1-en-1-il) -5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a] piridina-8-carboxilato de metilo = 4/1].

^{1}H NMR de3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 7.97 (d, 1H, J = 7.2Hz), 7.44 (d, 1H, J = 7.2Hz), 6.31-6.20 (m, 1H), 5.26-5.12 (m, 2H), 4.10 (s, 3H), 4.00 (dd, 2H, J = 6.3Hz, 1.2Hz).

^{1}H NMR de 3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílato de metilo ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 7.94 (d, 1H, J=6.0Hz), 7.42 (d, 1H, J=6.0Hz), 7.00-6.90 (m, 1H), 6.66-6.58 (m, 1H), 4.10 (s, 3H), 2.04 (dd, 3H, J=6.6Hz, 1.8Hz).

Punto de fusión: 121°C a 123°C

Paso 2; Síntesis del ácido 3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a]piridina -8-carboxílico y ácido 3- (prop-1-en-1-il) -5-(trifluorometil)-[1,2,4] triazolo[4,3-a] piridina-8-carboxílico

A la solución mixta de 720 mg (2.65 mmol) de la mezcla de 3-alil-5- (trifluorometil) -

[1,2,4]triazolo[4,3-a] piridina-8-carboxilato de metilo y 3- (prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxilato de metilo y 10 ml de etanol, se añadió 7.0 ml (3.5 mmol) de 0.5 mol/L de solución acuosa de hidróxido de sodio bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 30 minutos bajo enfriamiento con hielo. Después de terminar la agitación, se añadió ácido clorhídrico 1 M para ajustar el pH entre 2 y 3. A partir de entonces, la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (15 ml, 2 veces). La fase orgánica obtenida se deshidrató y se secó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico y sulfato de sodio anhidro en este orden y el solvente se separó mediante destilación bajo presión reducida para proporcionar 467 mg del producto deseado como un sólido blanco ácido [3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico/ácido 3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)- [1,2, 4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico = 4/1].

^{1}H NMR de ácido 3-alil-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 8.25 (d, 1H, J=7.5Hz), 7.61 (d, 1H, 7.5Hz), 6.34-6.20 (m, 1H), 5.35-5.22 (m, 2H), 4.00 (dd, 2H, J=6.3Hz, 1.2Hz). (No se observó el pico del protón CO2H).

^{1}H NMR de ácido3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico ($CDCl_3$, Me_4Si, 300MHz) δ 8.22 (d, 1H, J=8.1Hz), 7.58 (d, 1H, J=8.1Hz), 7.12-7.00 (m, 1H), 6.67-6.60 (m, 1H), 2.07 (dd, 3H, J=6.9Hz, 1.8Hz). (No se observó el pico del protòn CO_2H).

Punto de fusión: 103°C a 104°C

Paso 3; Síntesis de 3-alil-N- (5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)[l, 2,4] triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida y N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxamida

A la solución mixta de 100 mg (0.37 mmol) de la mezcla del ácido 3-alil-5-(trifluorometil) -[1,2,4]triazolo[4,3-a] piridina-8-carboxílico y ácido 3-(prop-1-en-1-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina-8-carboxílico, 55 mg (0.55 mmol) de 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-amina, 5 mg (0.04 mmol) de 1-hidroxi-7-azabenzotriazol y 2 ml de N,N-dimetilformamida, se añadió 106 mg (0.55 mmol) de hidrocloruro de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida a temperatura ambiente. Después de terminar la adición, la mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. Después de terminar la agitación, se añadió 3 ml de mol/ácido clorhídrico y el líquido de reacción se extrajo con acetato de etilo (10 ml, 2 vez). La fase orgánica obtenida se lavó con salmuera. A partir de entonces, la fase orgánica se secó sobre sulfato de sodio

COMPUESTO HETEROCÍCLICO DE AMIDA

CAMPO TÉCNICO

[0001] La presente invención se relaciona con un nuevo compuesto heterocíclico de amida y su sal, y productos químicos agrícolas, en particular herbicidas, que contienen el compuesto de amida heterocíclica o su sal como ingrediente activo. El producto químico agrícola en la presente invención significa un insecticida/acaricida, un nematicida, un herbicida, un bactericida y similares dentro de los campos agrícola y hortícolas.

ANTECEDENTES

[0002] Por ejemplo, cierto tipo de compuestos heterocíclicos de amida han sido dados a conocer en Documentos de Patentes del 1 al 6. Sin embargo el compuesto heterocíclico de amida no ha sido dado a conocer en absoluto.

Documentos del estado de la técnica

Patentes

[0003] Documento 1: Publicación Internacional No. 2012/028579 (WO 2012/028579)

Documento 2: Publicación Internacional No. 2012/123409 (WO 2012/123409)

Documento 3: Publicación Internacional No. 2012/123416 (WO 2012/123416)

Documento 4: Publicación Internacional No. 2012/126932 (WO 2012/126932)

Documento 5: Publicación Internacional No. 2013/017559 (WO 2013/017559)

Documento 6: Publicación Internacional No. 2013/064457 (WO 2013/064457)

RESUMEN

Problema a Resolver

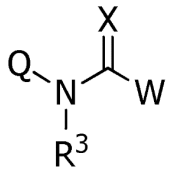
[0004] El objeto de la presente invención es proveer una sustancia química que efectivamente produzca efectos sobre varias malezas con la aplicación de pequeñas cantidades del químico, con una reducida contaminación del suelo e influencia sobre las cosechas subsiguientes, con un alto nivel de seguridad, y que sea útil como componente activo de herbicidas.

Medios para resolver el Problema

[0005] Como resultado de una exhaustiva investigación para resolver el problema, los inventores de la presente invención encontraron que un nuevo compuesto heterocíclico de amidade formula (1) de acuerdo a la presente invención tiene una excelente actividad herbicida como herbicida y un alto nivel de seguridad dirigido a cultivos sin mostrar efectos adversos sobre creaturas tales como mamíferos, peces, e insectos benéficos, y que es un compuesto muy útil , y así sus inventores han realizado la presente invención.

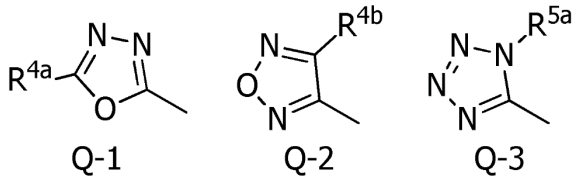
[0006] Más específicamente, la presente invención se relaciona con los siguientes [1] a [115] asuntos.

[1] Un compuesto de amida heterocíclica de formula (1):

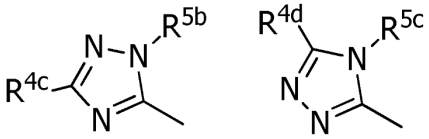


(1)

Donde Q es un heterociclo aromático de cada uno de Q1 a Q5.

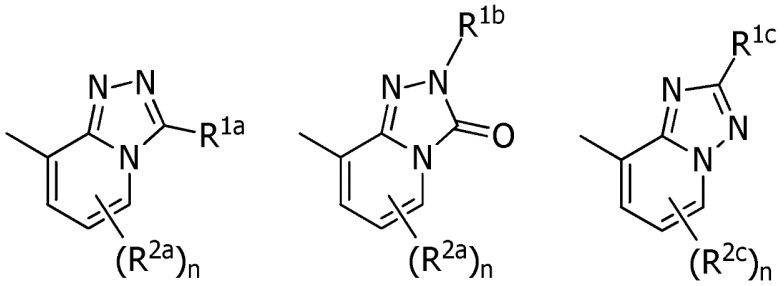


Q-1 Q-2 Q-3



Q-4 Q-5

W es un heterociclo aromático de W-1, W-2 o W-3;



W-1 W-2 W-3

X es un átomo de oxígeno o de azufre;

R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquilo C_{3-6}, (cicloalquilo C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6, alquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6}, - C (O) R^8, -C (O) OR^{16}, ciano, -OR^9, -$S(O)_{m1}R^{10}$, -N (R^{11}) R^{12}, -C (= NR^{12b}) R^{8b}, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, naftilo, o cualquier grupo de U-1 a U-25;

R^{1b} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquiloC_{3-6}, (cicloalquiloC_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6, alqueniloC_{2-6}, C_{2-6} alquinilo, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, naftilo, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6-miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

R^{1c} es alquiloC1-6;

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, haloalquiloC_{1-6}, - C (O) R^{18}, -C (O) OR^{24}, ciano, nitro, -OR^{19},-$S(O)_{m3}R^{20}$, -N (R^{21})^{22}, fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$; siendo n un entero de 2 o más, R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes unos de otros, y cuando dos R^{2a} están adyacentes, las dos adyacentes R^{2a} forman opcionalmente un anillo de 6 miembros con átomos de carbono unidos a cada R^{2a} formando -CH = CH-CH = CH-;

$R^{2\,c}$ es haloalquiloC_{1-6};

R^3 es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquiloC_{3-6}, alqueniloC_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, -C (O) R^{25} o -C (O) OR^{26};

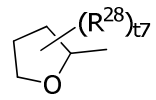
R^{4a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquiloC_{3-6}, (cicloalquilo C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^{27}, alquenilo C_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, haloalquiniloC_{2-6}, cicloalqueniloC_{3-6}, -NH_2,

alquilaminaC$_{1-6}$, di(alquiloC1-6)amina, - NHC (O) R^{8}, fenilo, fenilo sustituido con (R^{28})$_{r}$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

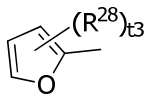
R^{4b} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, ciano, nitro, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C$_{3-6}$, cicloalquilo (C$_{3-6}$) opcionalmente sustituido con R^{27}, alqueniloC$_{2-6}$, haloalqueniloC$_{2-6}$, alquiniloC$_{2-6}$, haloalquiniloC$_{2-6}$, cicloalqueniloC$_{3-6}$, - C (O) OR^{16}, -OR^{38},-S(O)$_{m3}$R^{20}, -NH$_2$, alquilaminaC$_{1-6}$, di(alquilC$_{1-6}$) amina, - NHC (O) R^{8}, fenilo, fenilo sustituido con (R^{28})$_{r}$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

R^{4c} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquiloC$_{3-6}$, (cicloalquiloC$_{3-6}$) opcionalmente sustituido con R^{27}, fenilo, fenilo sustituido con (R^{28})$_{r}$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

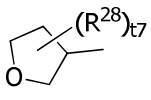
R^{4d} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{35}; U-1 a U-6, U-6a, U-7 a U-10, U-10, U-11, U-11, U-12, U-12a, U-13, U-13, U-14 U-22, U-22a, U-23, U-24, U-25 y U-26 son respectivamente heterociclos de las siguientes estructuras:



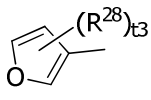
U-1



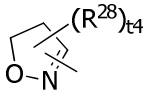
U-2



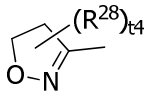
U-3



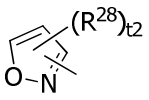
U-4



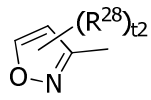
U-5



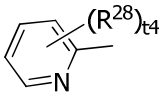
U-5a



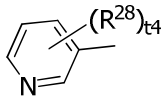
U-6



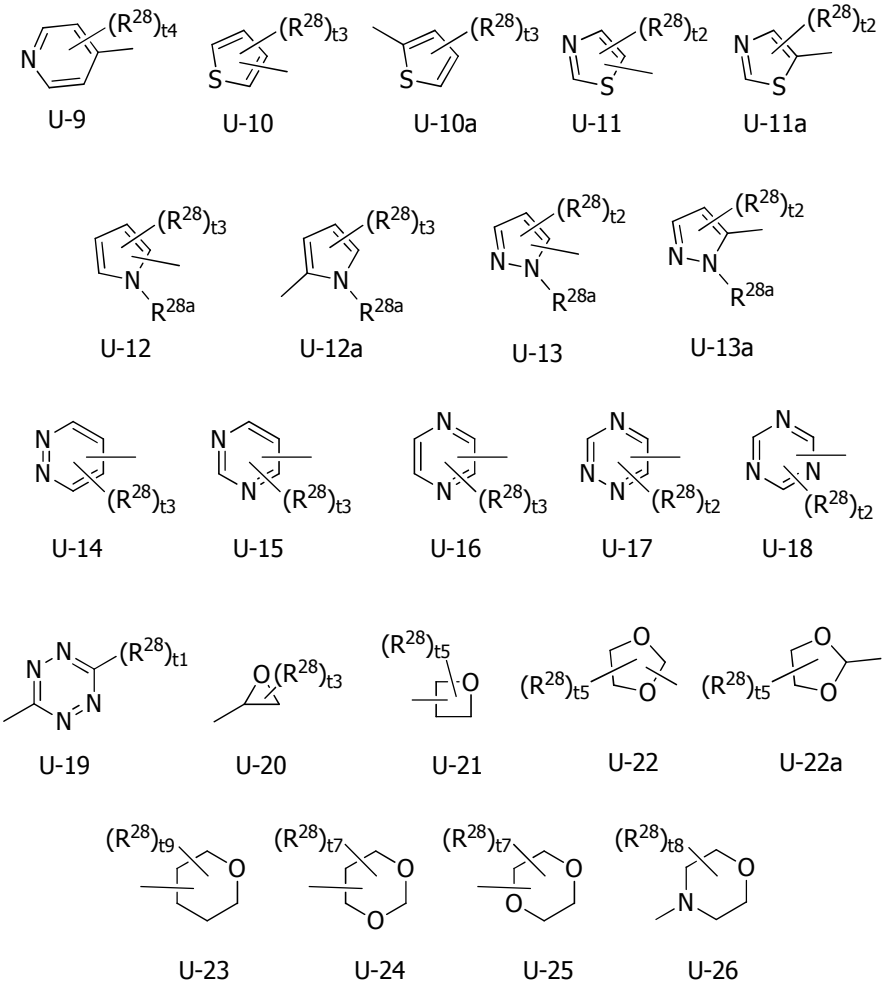
U-6a



U-7



U-8



R^{5a} yR^{5b} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquiloC_{3-6}, halocicloalquiloC_{3-6}, alqueniloC_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, haloalquiniloC_{2-6}, cicloalqueniloC_{3-6}, fenilo o fenilo sustituido con $(R^{28})_r$;

R^{5c} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{36} o R^{5c} opcionalmente forma un anillo de 6 miembros con un nitrógeno átomo al que R^{5c} está unido y un átomo de carbono al que R^{4d} se enlaza para formar -$(CH_2)_4$- o -CH = CH-CH = CH- con R^{4d};

R^6 es un átomo de halógeno, ciano, nitro, cicloalquilo C_{3-6}, - C (O) R^8, -C (O) OR^{16}, -OR^{13}, -S(O) $_{m2}$ R^{14}, fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$;

R^7 es un átomo de halógeno, ciano, nitro, alquiloC1-6, alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquiloC_{3-6}, halocicloalquiloC_{3-6}, alqueniloC_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, haloalquiniloC_{2-6}, cicloalqueniloC_{3-6}, alquiniloC_{1-6}, cicloalquilcarboniloC_{3-6},

haloalquilcarbonilo C_{1-6}, halocicloalquilcarbonilo C_{3-6}, alcoxicarbonilo C_{1-6}, haloalcoxicarbonilo C_{1-6}, alquilaminocarbonilo C_{1-6}, haloalquilaminocaronilo C_{1-6}, di(alquilamino C_{1-6}) carbonilo, -OR^{15}, -$S(O)_{m3}R^{20}$, alquilaminosulfonilo C_{1-6}, di(alquilC_{1-6}) aminosulfonilo, -NH_2, alquilaminaC_{1-6}, di(alquiloC1-6)amina, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

R^8 es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o -N R (R^{11a}) R^{12a}

R^{8b} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^9 es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o fenilo;

R^{10} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6} o haloalquinilo C_{2-6};

R^{11} y R^{12} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6} o haloalquinilo C_{2-6}; fenilosulfonilo, fenilo, fenilo sustituido $(R^7)_p$, U-7, U-8, U-9 y U-14 y U-19 o R^{11} opcionalmente forma un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al cual R^{11} y R^{12} se adhieren formando un alquileno C_{2-6} de cadena junto con R^{12}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene un O, S, S(O), $S(O)_2$, o N (R^{33}) y es opcionalmente sustituido con un grupo oxo o un grupo tioxo;

R^{12b} es -OR^{19b};

R^{13} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, - C (O) R^8 o fenilo;

R^{14} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, o fenilo;

R^{15} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6} o cicloalquenilo C_{3-6};

R^{16} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{37};

R^{18} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{19} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o fenilo;

R^{19b} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{20} es alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6} , haloalquinilo C_{2-6} o cicloalquenilo C_{3-6};

R^{21} y R^{22} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, o fenilo, o R^{21} opcionalmente forma un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al cual R^{21} y R^{22} están unidos formando una cadena de alquileno de 2-6 carbones con R^{22}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene un O , S, S(O), $S(O)_2$, o N (R^{39}) y está opcionalmente sustituido con un grupo oxo o un grupo de tioxo;

R^{24} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{25} y R^{26} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6} , cicloalquenilo C_{3-6} o fenilo;

R^{27} es un átomo de halógeno, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, -C (O) OR^{16}, -OR^{29}, -$S(O)_{m4}R^{30}$, heteroarilo de 5-6 miembros, heteroarilo de 5-6 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a}), heterociclilo de 3-7 miembros o heterociclilo de 3-7 miembros (opcionalmente sustituido con R^{28} y R^{28a});

R^{28} es un halógeno átomo, ciano, nitro, alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, (alcoxilo C_{1-6}) alquiloC1-6, -OR^{31} o $S(O)_{m4}R^{30}$; cuando t2, t3, t4, t5, t7, t8 o t9 es un entero de 2 o más, R^{28} opcionalmente son iguales o diferentes entre sí; más cuando dos R^{28} son adyacentes, las dos adyacentes R^{28} opcionalmente forman un anillo de 6 miembros con átomos de carbono al cual cada R^{28} se une formando -CH = CH-CH = CH-;

R^{28a} es alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, (alcoxilo C_{1-6}) alquiloC1-6 o (alquiltio C_{1-6}) alquiloC1-6

R^{29}, R^{30} y R^{31} son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquiniloC$_{2-6}$, haloalquinilo C_{2-6}, cicloalqueniloC$_{3-6}$ o fenilo;

R^{33} es un átomo de hidrógeno o AlquiloC1-6;

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C_{3-6}, - C (O) R^8, -C (O) OR^{16}, -OR^{33}, -$S(O)_{m6}R^{33}$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-1 U-3, U-7, U-8, U-9 y U-14 a U-25;

R^{35} es un átomo de halógeno o alcoxilo C_{1-6};

R^{36} es un átomo de halógeno o alcoxilo C_{1-6};

R^{37} es alcoxilo C_{1-6};

R^{38} es alquiloC1-6, alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquiloC_{3-6}, halocicloalquiloC_{3-6}, alqueniloC_{2-6}, haloalqueniloC_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, haloalquiniloC_{2-6}, cicloalqueniloC_{3-6} o fenilo;

R^{39} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

t1 es un entero de 0 o 1;

m1, m2, m3, m4, m6 y el t2 son cada uno independientemente un número entero de 0, 1 o 2;

n y t3 son cada uno independientemente un número entero de 0, 1, 2 o 3;

p y r son cada uno independientemente un número entero de 1, 2, 3, 4 o 5;

[0007] [2]

La amida heterocíclica compuesta o la sal misma según [1], en la que W es un heterociclo aromático de 1 W o W-2; y

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, haloalquiloC_{1-6}, - C (O) R^{18}, -C (O) OR^{24}, ciano, nitro, -o^{19}, o-S(O) $_{m3}$ R^{20}, y cuando n es un entero de 2 o más, R^{2a} opcionalmente igual o diferentes unos de otros.

[0008] [3]

El compuesto amida heterocíclico, o la sal del mismo según [2], en la cual R^{1b} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquilo C_{3-6}, (C_{3-6} cicloalquilo) opcionalmente sustituido con R^6, alquenilo C_{2-6}, alquiniloC_{2-6}, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, naftilo o cualquier grupo de U-1 a U-25;

R^{4a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^{27}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6}, - NH_2, alquilamina C_{1-6}, di(alquil $_{1-6}$) amina, - NHC (O) R^8, fenilo , fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, o cualquier grupo de U-1 a U-26;

R^7 es un átomo de halógeno, ciano, nitro, alquiloC1-6, alquilo (C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, halocicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6}, alquenilcarbonilo C_{1-6}, cicloalquilcarbonilo C_{3-6}, haloalquilcarbonilo C_{1-6}, halocicloalquilcarbonilo C_{3-6}, alcoxilcarbonilo C_{1-6},

haloalcoxilcarbonilo C_{1-6}, alquilaminocarbonilo C_{1-6}, haloalquilaminocarbonilo C_{1-6}, di(alquilaminoC_{1-6}) carbonilo, -OR^{15}, -$S(O)_{m3}R^{20}$, alquilaminosulfonilo C_{1-6}, di(alquiloC1-6) aminosulfonilo, -NH_2, alquilamina C_{1-6}, di(alquiloC1-6) amina, o cualquier grupo de U-1 a U-26; y

R^{27} es un átomo de halógeno, ciano, nitro, fenilo, fenilo sustituido $(R^{28})_r$, -C (O) OR^{16}, -OR^{29},-$S(O)_{m4}R^{30}$ o cualquier grupo de U-1 a U-26.

[0009] [4]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal del mismo según [3], en la cual R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquilo C_{3-6}, (cicloalquilo C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6, alquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6}, - C (O) R^8, -OR^9, -$S(O)_{m1}R^{10}$, -N (R^{11}) R^{12}, -C (= N^{12b}) R^{8b}, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-3, U-5a, U-6a, U-7, U-8, U-10a, U-11a, U-12a o U-13a;

R^{1b} es alquiloC1-6 o (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6} o -$S(O)_{m3}R^{20}$, y cuando n es un entero de 2 o más, los R^{2a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí;

R^3 es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{4a} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, cicloalquilo C_{3-6}, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$ o un heterociclo de U-1, U 2, U-7, U-10 y U-26;

R^{4b} es alquiloC1-6;

R^{4c} es un átomo de hidrógeno;

R^{d4} es alquiloC1-6;

R^{5a} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R_{27}, alquenilo C_{2-6} o fenilo;

R^{5b} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{5c} es alquiloC1-6, o R^{5c} opcionalmente forma un anillo de 6 miembros con un átomo de nitrógeno al que R^{5c} está unido y un átomo de carbono al que R^{4d} se enlaza mediante la formación de -$(CH_2)_4$- o -CH = CH-CH = CH-R^{4d};

R^7 es un átomo de halógeno, alquiloC1-6; (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, o -OR^{15};

R^{8b} es un átomo de hidrógeno;

R^9 es alquiloC1-6;

R^{10} es alquiloC1-6; (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6} o alquinilo C_{2-6};

R^{11} es alquiloC1-6; (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6} o alquinilo C_{2-6}, fenilosulfonilo, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$ o U-7;

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{11} opcionalmente forma un anillo de 5-6-miembros junto con un átomo de nitrógeno al cual R^{11} y R^{12} están unidos formando una cadena de alquilenoC_{4-5} junto con R^{12}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene un O, S, S(O) o $S(O)_2$;

R^{11a} es alquiloC1-6;

R^{12a} es un átomo de hidrógeno;

R^{13} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, - C (O) R^8 o fenilo;

R^{14} es alquiloC1-6 o (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{15} es alquiloC1-6;

R^{19b} es alquiloC1-6;

R^{20} es alquiloC1-6;

R^{27} es un átomo de halógeno, fenilo, fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, $-OR^{29}$, -C (O) OR^{16}, o -(O) $_{m4}$ R^{28} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, o $-OR^{31}$; cuando t2, t3, t4, t5 y t7 son enteros de 2 o más, las R^{28} opcionalmente son iguales o diferentes entre sí; y más cuando dos R^{28} son adyacentes, las dos adyacentes R^{28} opcionalmente forman un anillo de 6 miembros con átomos de carbono para que cada R^{28} se una formando -CH = CH-CH = CH-;

R^{29} es alquiloC1-6;

R^{30} es alquiloC1-6;

R^{31} es alquiloC1-6;

R^{33} es alquiloC1-6; y

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquiloC_{3-6}, - C (O) R^8, -C (O) OR^{16}, $-OR^{33}$,-S(O) $_{m6}$ R^{33}, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-1, U-8 o U-22a.

[0010] [5]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según [4], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-1; y

W es un heterociclo aromático de W-1.

[0011] [6]

La amida heterocíclica compuesta o la sal de la misma según [5], donde X es un átomo de oxígeno;

R^{1a} un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquilo C_{3-6}, (cicloalquilo C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6, alquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, cicloalquenilo C_{3-6}, - C (O) R^8, -OR^9, -$S(O)_{m1}R^{10}$, -N (R^{11}) R^{12}, - C (= N^{12b}) R^{8b}, fenilo , fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-5a, U-6a, U-7, U-8, U-10a, U-11a, U-12a o U-13a;

R^{2a} es alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6} o-$S(O)_{m3}R^{20}$, y cuando n es un entero de 2 o más, R^{2a} opcionalmente son iguales o diferentes entre sí;

R^6 es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C_{3-6}, -C (O) R^8, -C (O) OR^{16}, -OR^{13},-$S(O)_{m2}R^{14}$ o fenilo sustituido con $(R^7)_p$; y

R^{27} es un halógeno átomo, fenilo, -$OR^{29,}$ o -$S(O)_{m4}R^{30}$.

[0012] [7]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según [6], en la cual R^{4a} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27} o cicloalquiloC_{3-6}; y

R^{27} es un átomo de halógeno o -OR^{29}.

[0013] [8]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según [4], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-3; y

W es un heterociclo aromático de W-1.

[0014] [9]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según [8], en la cual R^{1a} es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquiloC_{3-6}, cicloalquilo(C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6, alqueniloC_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, - C (O) R^8,-$S(O)_{m1}R^{10}$, -N (R^{11}) R^{12} , fenilo, fenilo sustituido $(R^7)_p$, U-3, U-5a, U-6a, U-8, U-10a o U-13a;

R^{2a} es un átomo de halógeno, alquiloC1-6 o haloalquilo C_{1-6}, y cuando n es un entero de 2 o más, R^{2a} are opcionalmente iguales o diferentes entre sí;

R^6 es un átomo de halógeno, - C (O) OR^{16}, -OR^{13},-$S(O)_{m2}R^{14}$ o fenilo sustituido con $(R^7)_p$;

R^7 es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, o -OR^{15};

R^8 es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{11} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$;

R^{11} opcionalmente forma un anillo de 6 miembros con un átomo de nitrógeno al cual R^{11} y R^{12} están unidos formando una cadena de alquileno C_5 junto con R^{12}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene un O, S, S(O) o $S(O)_2$;

R^{16} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{27} es fenilo sustituido con $(R^{28})_r$, -OR^{29}, -C (O) OR^{16} o -$S(O)_{m4}R^{30}$;

R^{28} es un átomo de halógeno o alquiloC1-6; y

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano, C_{3-6} cicloalquilo, -OR^{33}, -$S(O)_{m6}R^{33}$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-1 y U-8.

[0015] [10]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según [9], en la cual R^{5a} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27} o alquenilo C_{2-6}; y

R^{27} es -OR^{29} o -$S(O)_{m4}R^{30}$.

[0016] [11]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [10], donde X es un átomo de oxígeno.

[0017] de [12]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [10], donde X es un átomo de azufre.

[0018] [13]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [12], en que R^3 es un átomo de hidrógeno.

[0019] [14]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [12], en que R^3 es alquiloC1-6.

[0020] [15]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [14], en que R^{2a} es haloalquilo C_{1-6}.

[0021] [16]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [14], en que R^{2a} es un átomo de halógeno.

[0022] [17]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [14], en que R^{2a} es $-S(O)_{m3}R^{20}$; y

R^{20} es alquiloC1-6.

[0023] [18]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [14], en que R^{2a} es trifluorometilo.

[0024] [19]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [18], en que n es un entero de 1, 2 o 3.

[0025] [20]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] [18], en que n es un entero de 1.

[0026] [21]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-2; y

W es un heterociclo aromático de W-1.

[0027] [22]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-4; y

W es un heterociclo aromático de W-1.

[0028] [23]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-5; y

W es un heterociclo aromático de W-1.

[0029] [24]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-1; y

W es un heterociclo aromático de W-2.

[0030] [25]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-2; y

W es un heterociclo aromático de W-2.

[0031] [26]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-3; y

W es un heterociclo aromático de W-2.

[0032] [27]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-4; y

W es un heterociclo aromático de W-2.

[0033] [28]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-5; y

W es un heterociclo aromático de W-2.

[0034] [29]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-1; y

W es un heterociclo aromático de W-3.

[0035] [30]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-2; y

W es un heterociclo aromático de W-3.

[0036] [31]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-3; y

W es un heterociclo aromático de W-3.

[0037] [32]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-4; y

W es un heterociclo aromático de W-3.

[0038] [33]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [20], en la que Q es un heterociclo aromático de Q-5; y

W es un heterociclo aromático de W-3.

[0039] [34]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [33], en que R^{4a} es un átomo de hidrógeno.

[0040] [35]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [33], en que R^{4a} es un átomo de hidrógeno o AlquiloC1-6.

[0041] [36]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [33], en que R^{4a} es AlquiloC1-6.

[0042] [37]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] [33], en que R^{4a} es C_{1-3} alquilo.

[0043] [38]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [33], en que R^{4a} es metilo.

[0044] [39]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [33], en que R^{4a} es etilo.

[0045] [40]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [33], en que R^{4a} es cicloalquilo C_{3-6}.

[0046] [41]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [33], en que R^{4a} es haloalquilo C_{1-3}.

[0047] [42]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [41], en que R^{5a} es un átomo de hidrógeno.

[0048] [43]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [41], en que R^{5a} es alquiloC1-6.

[0049] [44]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [41], en que R^{5a} es alquiloC_{1-3}.

[0050] [45]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [41], en que R^{5a} es metilo.

[0051] [46]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [41], en que R^{5a} es etilo.

[0052] [47]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [41], en la cual R^{5a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27};

R^{27} es $-OR^{29}$ o $-S(O)_{m4}R^{30}$;

R^{29} es alquiloC1-6; y

R^{30} es alquiloC1-6.

[0053] [48]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [41], en que R^{5a} es alquenilo C_{2-6}.

[0054] [49]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6, cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6, alquenilo C_{2-6}, - CHO,$-S(O)_{m1}R^{10}$, $-N(R^{11})R^{12}$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$, U-3, U-5a, U-6a, U-7, U-8, U-10a, U-11a, U-12a o U-13a;

R^6 es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquilo C_{3-6}, $-C(O)OR^{16}$, $-OR^{13}$,$-S(O)_{m2}R^{14}$, fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$;

R^8 es alquiloC1-6;

R^{10} alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquiloC_{3-6} o alqueniloC$_{2-6}$;

R^{11} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquiloC_{3-6}, alqueniloC$_{2-6}$, fenilo, fenilo sustituido con $(R^7)_p$ o U-7;

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{11} opcionalmente forma un anillo de 5-6 miembros junto con un átomo de nitrógeno al cual R^{11} y R^{12} están unidos formando una cadena de alquileno C_{4-5} junto con R^{12}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene un O, S, S(O) o $S(O)_2$;

R^{13} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{14} alquiloC1-6 o (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{16} es un átomo de hidrógeno, alquiloC1-6 o (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{37}; y

R^{34} es ciano, cicloalquilo C_{3-6}, - C (O) R^8, -C (O) OR^{16}, -OR^{33}, -$S(O)_{m6}R^{33}$o U-1.

[0055] [50]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es alquiloC1-6, cicloalquilo C_{3-6}, alquenilo C_{2-6} o - CHO.

[0056] [51]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es alquiloC1-6 o cicloalquilo C_{3-6}.

[0057] [52]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es alquiloC1-6.

[0058] [53]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es cicloalquilo C_{3-6}.

[0059] [54]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6; y

R^6 es un átomo de halógeno.

[0060] [55]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6; y

R^6 es ciano.

[0061] [56]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6; y

R^6 es cicloalquilo C_{3-6}.

[0062] [57]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6; y

R^6 es - C (O) OR^{16}.

[0063] [58]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es -OR^{13}; y

R^{13} es alquiloC1-6.

[0064] [59]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es -OR^{13};

R^{13} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{34} es -OR^{33}; y

R^{33} es alquiloC1-6.

[0065] [60]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es-$S(O)_{m2}R^{14}$;

R^{14} alquiloC1-6 o alquil (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{34} es un átomo de halógeno o -OR^{33}; y

R^{33} es alquiloC1-6.

[0066] [61]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es $-S(O)_{m2}R^{14}$;

R^8 es alquiloC1-6;

R^{14} (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{16} es alquiloC1-6;

R^{34} es ciano, cicloalquilo C_{3-6}, $-C(O)R^8$, $-C(O)OR^{16}$, $-OR^{33}$o $-S(O)_{m6}R^{33}$; y

R^{33} es alquiloC1-6.

[0067] [62]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es $-S(O)_{m2}R^{14}$; y

R^{14} es alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6} o haloalquinilo C_{2-6}.

[0068] [63]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6; y

R^6 es un átomo de halógeno.

[0069] [64]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es cicloalquilo (C_{3-6}) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es $-OR^{13}$; y

R^{13} es alquiloC1-6.

[0070] [65]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-$S(O)_{m1}R^{10}$.

[0071] [66]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-$S(O)_{m1}R^{10}$;

R^{10} es alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6} o alquenilo C_{2-6};

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano, cicloalquiloC_{3-6}, - C (O) R^8, -C (O) OR^{16}, o -OR^{33};

R^8 es alquiloC1-6;

R^{16} es alquiloC1-6; y

R^{33} es alquiloC1-6.

[0072] [67]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-S(O) $_{m1}$ R^{10}; y

R^{10} es alquiloC1-6.

[0073] [68]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-S(O) $_{m1}$ R^{10}; y

R^{10} es cicloalquilo C_{3-6}.

[0074] [69]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-S(O) $_{m1}$ R^{10}; y

R^{10} es alquenilo C_{2-6}.

[0075] [70]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-S(O) $_{m1}$ R^{10}; y

R^{10} es alquinilo C_{2-6}.

[0076] [71]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-S(O) $_{m1}$ R^{10};

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es un átomo de halógeno.

[0077] [72]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-S(O) $_{m1}$ R^{10};

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con $R^{34;}$ y

R^{34} es ciano.

[0078] [73]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-$S(O)_{m1}R^{10}$;

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con $R^{34;}$ y

R^{34} es cicloalquilo C_{3-6}.

[0079] [74]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-$S(O)_{m1}R^{10}$;

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{34} es -$C(O)R^{8}$ -$C(O)OR^{16}$;

R^{8} es alquiloC1-6; y

R^{16} es alquiloC1-6.

[0080] [75]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-$S(O)_{m1}R^{10}$;

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{34} es -OR^{33}; y

R^{33} es alquiloC1-6.

[0081] [76]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es-$S(O)_{m1}R^{10}$

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{34} es -$S(O)_{m6}R^{33}$; y

R^{33} es alquiloC1-6.

[0082] [77]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R_{1a} es -$N(R^{11})R^{12}$.

[0083] [78]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -$N(R^{11})R^{12}$;

R^{11} es alquiloC1-6;

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6.

[0084] [79]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12};

R^{11} es (AlquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}, cicloalquilo C_{3-6} o alquenilo C_{2-6} ;

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{34} es un átomo de halógeno, ciano o-$S(O)_{m6}$ R^{33}; y

R^{33} es alquiloC1-6.

[0085] [80]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12};

R^{11} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{34} es -OR^{33}; y

R^{33} es alquiloC1-6.

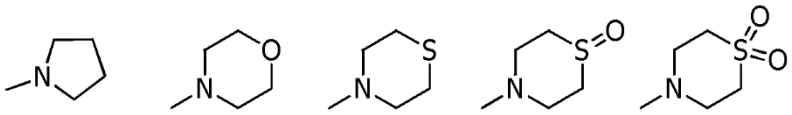
[0086] [81]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12}; y

R^{11} opcionalmente forma un anillo de 5-6 miembros junto con un átomo de nitrógeno al cual R^{11} y R^{12} están unidos formando una cadena de C_{4-5} alquileno junto con R^{12}, y en este caso, la cadena alquileno opcionalmente contiene un O, S, S(O) o $S(O)_2$.

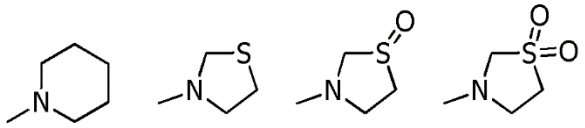
[0087] [82]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es un sustituto de las siguientes fórmulas de estructura:



[0088] [83]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es un sustituto de las siguientes fórmulas de estructura:



[0089] [84]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$.

[0090] [85]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6; y

R^6 es fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$.

[0091] [86]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es $-OR^{13}$;

R^{13} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$.

[0092] [87]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es $-S(O)_{m2}R^{14}$;

R^{14} (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$.

[0093] [88]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es $-S(O)_{m1}R^{10}$;

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

[0093] [88]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es $-S(O)_{m1}R^{10}$;

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es fenilo o fenilo sustituido con $(R^7)_p$.

[0094] [89]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12};

R^{11} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6;

R^{34} es fenilo o fenilo sustituido con (R^7) $_p$.

[0095] [90]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12};

R^{11} es fenilo o fenilo sustituido con (R^7) $_p$; y

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6.

[0096] [91]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [84] al [90], en que R^7 es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27} o -OR^{15};

R^{15} es alquiloC1-6;

R^{27} es un átomo de halógeno, -OR^{29} o -S(O) $_{m4}$ R^{30}; y

R^{29} y R^{30} son cada uno independientemente alquiloC1-6.

[0097] [92]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [84] al [90], en que R^7 es un átomo de halógeno, alquiloC1-6, (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{27}, o -OR^{15};

R^{15} es alquiloC1-6; y

R^{27} es un átomo de halógeno.

[0098] [93]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es de heterociclos de U-1 a U-25.

[0099] [94]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es U 3, U-5a, U-6a, U-7, U-8, U-10a, U-11a, U-12a o U-13a.

[0100] [95]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12}; y

R^{11} es U-7, U-8, U-9 o U-14 a U-19; y

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6.

[0101] [96]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12};

R^{11} es U-7; y

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6.

[0102] [97]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -S(O) $_{m1}$ R^{10};

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es U-7, U-8, U-9 o U-14 a U-19.

[0103] [98]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -S(O) $_{m1}$ R^{10};

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es U 1, U-3 o U-20 a U-25.

[0104] [99]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -S(O) $_{m1}$ R^{10};

R^{10} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es U-1, U-3 o U-22a.

[0105] [100]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12};

R^{11} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6; y

R^{34} es U-7, U-8, U-9 y U-14 a U-19.

[0106] [101]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12};

R^{11} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6; y

R^{34} es U 1, U-3 y U-20 a U-25.

[0107] [102]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en que R^{1a} es -N (R^{11}) R^{12};

R^{11} es alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con R^{34};

R^{12} es un átomo de hidrógeno o alquiloC1-6; y

R^{34} es U-1, U-3 o U-22a.

[0108] [103]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es -OR^{13};

R^{13} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es U-7, U-8, U-9 y U-14 a U-19.

[0109] [104]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es -OR^{13};

R^{13} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es U 1, U-3 o U-20 a U-25.

[0110] [105]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es -OR^{13};

R^{13} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es U-1, U-3 o U-22a.

[0111] [106]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^6;

R^6 es –$S(O)_{m2}R^{14}$;

R^{14} (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es U-7, U-8, U-9 o U-14 a U-19.

[0112] [107]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{6};

R^{6} es $–S(O)_{m2}R^{14}$;

R^{14} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es U-1, U-3 o U-20 a U-25.

[0113] [108]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [48], en la cual R^{1a} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{6};

R^{6} es $–S(O)_{m2}R^{14}$;

R^{14} es (alquiloC1-6) opcionalmente sustituido con R^{34}; y

R^{34} es U-1, 3 U o U-22a.

[0114] [109]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [93] a [108], en el que t1, t2, t3, t4, t5, t7, t8 y t9 son cada uno independientemente un número entero de 0.

[0115] [110]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [93] a [108], en que R^{28} es un átomo de halógeno, ciano, alquiloC1-6, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, (C_{1-6} alcoxilo) alquiloC1-6, $-o^{31}o-S(O)_{m4}R^{30}$.

[0116] [111]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [93] a [108], en que R^{28} es un átomo de halógeno.

[0117] [112]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [93] a [108], en que R^{28} es alquiloC1-6.

[0118] [113]

El compuesto amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [93] a [108], en que R^{28} es alcoxiloC_{1-6}.

[0119] [114]

Un químico agrícola que comprende uno, dos o más compuestos de amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [113] como un componente activo.

[0120] [115]

Un herbicida que comprende uno, dos o más compuestos de amida heterocíclica, o la sal de la misma según alguno de [1] a [113] como un componente activo.

Efectos de la invención

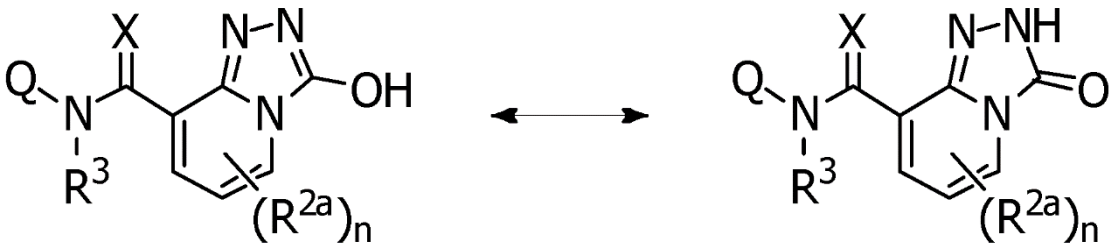
[0121] Los compuestos de la presente invención poseen excelente actividad herbicida para varias malas hierbas y un alto nivel de seguridad a los cultivos objetivo. Además, los compuestos de la presente invención no tienen casi ningún efecto adverso sobre distintos criaturas tales como mamíferos, peces e insectos beneficiosos y tienen liviana carga ambiental debido a las bajas propiedades residuales.

Por consiguiente, la presente invención puede proporcionar un herbicida útil en los campos agrícolas y hortícolas tales como campos de arroz, campos secos y huertos.

MODOS PARA REALIZAR EL INVENTO

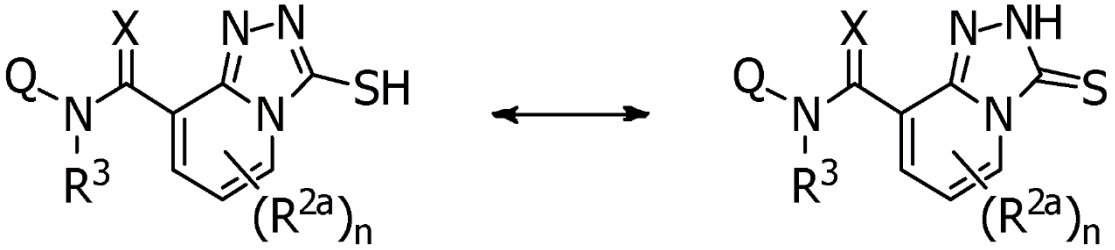
Los compuestos incluidos en la presente invención pueden incluir los isómeros geométricos de una forma E y una forma Z dependiendo de los sustituyentes. La presente invención incluye la forma-E, la forma de Z, y una mezcla de los E-forma y la forma de Z en cualquier proporción. Los compuestos incluidos en la presente invención incluyen isómeros ópticamente activos debido a la existencia de uno o dos o más de los átomos de carbono asimétricos. La presente invención incluye todos los isómeros ópticamente activos o formas racémicas.

Los compuestos incluidos en la presente invención pueden incluir tautómeros dependiendo de los sustituyentes. La presente invención incluye todos los tautómeros o una mezcla de los tautómeros incluidos en cualquier proporción. Por ejemplo, en el caso del compuesto de la Fórmula (1): [donde W es W-1; R^{1a} es un grupo hidroxi; n, Q, $R^{2a,}$ $R^{3,}$ y X significa lo mismo que se ha descrito anteriormente], se incluyen los siguientes tautómeros.



Del mismo modo, en el caso del compuesto de la Fórmula (1):

[donde W es W-1; R^{1a} es un grupo -SH; n, Q, R^{2a}, R^{3}, y X significa lo mismo que se ha descrito anteriormente], se incluyen los siguientes tautómeros.



Entre los compuestos incluidos en la presente invención, los compuestos que pueden formar sales de adición ácida mediante un método convencional pueden formar, por ejemplo, las sales de ácidos hidrácidos, como ácido fluorhídrico, ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, y ácido yodhídrico; las sales de ácidos inorgánicos tales como ácido nítrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido clórico, ácido perclórico; y las sales de ácidos sulfónicos tales como ácido metanosulfónico, ácido etanosulfónico, ácido trifluorometanosulfónico, ácido bencenosulfónico, y ácido p-toluenosulfónico; las sales de ácidos carboxílicos tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido trifluoroacético, ácido fumárico, ácido tartárico, ácido oxálico, ácido maleico, ácido málico, ácido succínico, ácido benzoico, ácido mandélico, ácido ascórbico, ácido láctico, ácido glucónico, y ácido cítrico; o las sales de aminoácidos tales como ácido glutámico y ácido aspártico.

Entre los compuestos incluidos en la presente invención, los compuestos que pueden formar sal de metal mediante un método convencional pueden formar, por ejemplo, las sales de metales alcalinos tales como litio, sodio, y potasio; las sales de metales alcalinotérreos tales como calcio, bario y magnesio; o la sal de aluminio.

Ejemplos específicos de cada sustituyente descrito en esta especificación se describen a continuación. Aquí, n- significa normal; i- significa iso; s- significa secundario; y terc significa

terciario y Ph significa fenilo.

Los ejemplos del átomo de halógeno en la presente especificación pueden incluir un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, y un átomo de yodo. La expresión de "halo" en esta especificación es también estos átomos de halógeno.

La expresión de alquilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo de hidrocarburos lineal o ramificado una que tiene un número de átomos de carbono de a a b. Ejemplos específicos del alquilo C_{a-b} pueden incluir grupo metilo, grupo etilo, grupo nn-propilo, grupo i-propilo, grupo n-butilo, grupo i-butilo, grupo s-butilo, grupo terc-butilo, grupo n-pentilo, grupo 1,1-dimetil propilo, grupo n-hexilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión cicloalquilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo hidrocarburo cíclico que tiene un número de átomos de carbono de a a b y puede formar una estructura monocíclica o una estructura de anillo condensado de un anillo de 3 miembros a un anillo de 6 miembros. Cada anillo puede ser opcionalmente sustituido por un grupo alquilo en un rango del número especificado de átomos de carbono. Ejemplo específico del cicloalquilo C_{a-b} puede incluir el grupo ciclopropilo, grupo 1-metilciclopropilo, grupo 2-metilciclopropilo, grupo 2,2-dimetilciclopropilo, grupo ciclobutilo, grupo ciclopentilo, grupo ciclohexilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión halocicloalquilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo hidrocarburo cíclico que tiene un número de átomos de carbono de a a b en el que el átomo de hidrógeno unido al átomo de carbono está opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno y puede formar una estructura monocíclica o una estructura de anillo condensado de un anillo de 3 miembros a un anillo de 10 miembros. Cada anillo puede ser opcionalmente sustituido por un grupo alquilo en un rango del número especificado de átomos de carbono. La posición de sustitución con el átomo de halógeno puede ser en una parte de la estructura del anillo, en una parte de la estructura de la cadena lateral, o en ambas de estas. Cuando dos o más átomos de halógeno se utilizan como sustituyentes, estos átomos de halógeno son opcionalmente iguales o diferentes entre sí. Ejemplos específicos del halocicloalquilo C_{a-b} pueden incluir grupo 2,2-difluorociclopropilo, grupo 2,2-diclorociclopropilo, grupo 2,2-dibromociclopropilo, grupo 2,2-difluoro-1-metilciclopropilo, grupo 2,2-dicloro-1-metilciclopropilo, grupo 2,2-dibromo-1-metilciclopropilo, grupo 2,2,3,3-tetra-fluorocyclobutilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de

átomos de carbono.

La expresión de alquenilo C_{a-b} en esta especificación es un un grupo hidrocarburo insaturado lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono de a a b y que tiene uno o dos o más enlaces dobles en la molécula. Ejemplos específicos del alquenilo C_{a-b} pueden incluir grupo grupo vinilo, grupo 1-propenilo, grupo 2-propenilo, grupo 1-metil-etenilo, grupo 2-butenilo, grupo 2-metil-2-propenilo, grupo 3-metil-2-butenilo, grupo 1,1-dimetil-2-propenilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de haloalquenilo C_{a-b} en esta especificación es un un grupo hidrocarburo insaturado lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono de a a b en los que el átomo de hidrógeno unido al átomo de carbono está opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno y tiene uno o dos o más enlaces dobles en la molécula. En este caso, cuando dos o más átomos de halógeno se utilizan como sustituyentes, estos átomos de halógeno son opcionalmente iguales o diferentes entre sí. Ejemplos específicos del haloalquenilo C_{a-b} pueden incluir grupo 2,2-diclorovinilo, grupo 2-fluoro-2-propenilo, grupo 2-cloro-2-propenilo, grupo 3-cloro-2-propenilo, grupo 2-bromo-2-propenilo, grupo 3,3-difluoro-propenilo, grupo 2,3-dicloro-2-propenilo, grupo 3,3-dicloro-2-propenilo, grupo 2,3,3-trifluoro-2-propenilo, 2,3, 3-tricloro-2-propenilo, grupo 1-(trifluorometil)etenilo, grupo 4,4-difluoro-3-butenilo, grupo 3,4,4-trifluoro-3-butenilo, 3-cloro-4,4,4-trifluoro-2-butenilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión cicloalquenilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo hidrocarburo cíclico insaturado que tiene un número de átomos de carbono entre a y b y que tiene uno o dos más enlaces dobles y puede formar una estructura monocíclica o una estructura de anillo condensado de un anillo de 3 miembros a un anillo de 6 miembros. Cada anillo puede ser sustituido por un grupo alquilo en un rango del número especificado de átomos de carbono. El enlace doble puede ser bien sea de forma endo o de la forma exo. El ejemplo específico de la cicloalquenilo C_{a-b} puede incluir grupo 1-ciclopenteno-1-ilo, grupo 2-ciclopenteno-1-ilo, grupo 1-ciclohexen-1-ilo, grupo 2-ciclohexen-1-ilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de alquinilo C_{a-b} en esta especificación es un un grupo hidrocarburo insaturado lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono de a a b y que tiene uno o dos o más enlaces triples en la molécula. Los ejemplos específicos del alquinilo C_{a-b} pueden incluir grupo

etinilo, grupo 1-propinilo, grupo 2-propinilo, grupo 1-butinilo, grupo 2-butinilo, grupo 3-butinilo, grupo 1,1-dimetil-2-propinilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de haloalquinilo C_{a-b} en esta especificación es un un grupo hidrocarburo insaturado lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono de a a b en los que el átomo de hidrógeno unido al átomo de carbono está opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno y tiene uno o dos o más enlaces triples en la molécula. En este caso, cuando dos o más átomos de halógeno se utilizan como sustituyentes, estos átomos de halógeno son opcionalmente iguales o diferentes entre sí. Los ejemplos específicos del haloalquinilo C_{a-b} pueden incluir grupo cloroetinilo, grupo 2-bromoetinilo, grupo 2-yodoetinilo, grupo 3-cloro-2-propinilo, grupo 3-bromo-2-propinilo, grupo 3-yodo-2-propinilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de haloalquilo C_{a-b} en esta especificación es un un grupo hidrocarburo lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono de a a b en los que el átomo de hidrógeno unido al átomo de carbono está opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno. Cuando dos o más átomos de halógeno se utilizan como sustituyentes, estos átomos de halógeno son opcionalmente iguales o diferentes entre sí. Los ejemplos específicos del haloalquilo C_{a-b} pueden incluir grupo fluorometilo, grupo clorometilo, grupo bromometilo, grupo yodometilo, grupo difluorometilo, grupo diclorometilo, un grupo trifluorometilo, grupo clorodifluorometilo, grupo triclorometilo, grupo bromodifluorometilo, un grupo 2-fluoroetilo, grupo 2-cloroetilo, grupo 2-bromoetilo, grupo 2,2-difluoroetilo, grupo 2,2,2-trifluoroetilo, grupo 2-cloro-2,2-difluoroetilo, grupo 2,2,2-tricloroetilo, grupo 1,1,2,2-tetrafluoroetilo, grupo 2-cloro-1,1,2-trifluoroetilo, grupo pentafluoroetilo, grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, grupo 1,1,2,3,3,3-hexafluoropropilo, grupo heptafluoropropilo, grupo 2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etilo, grupo 1,2,2,2-tetrafluoro-1- (trifluorometil)etilo, grupo 2,2,3,3,4,4,4-heptafluorobutilo, un grupo nonafluorobutilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de alcoxilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo alquil-O- en el cual este alquilo es el grupo alquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos de los grupos alcoxilo C_{a-b} pueden incluir grupo metoxilo, un grupo etoxilo, grupo n-propiloxilo, grupo i-propiloxilo, grupo n-butiloxilo, grupo i-butiloxilo, grupo s-butiloxilo, grupo

terc-butiloxilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de C_{a-b} alquiltio en esta especificación es un grupo alquil-S- en el cual este alquilo es el grupo alquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del alquiltio C_{a-b} pueden incluir grupo metiltio, grupo etiltio, grupo n-propiltio, grupo i-propiltio, grupo n-butiltio, grupo i-butiltio, grupo s-butiltio, grupo terc-butiltio y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

[0138] La expresión de C_{a-b} alquilcarbonilo en esta especificación es un grupo alquilo-C(O)- en el cual este alquilo es el grupo alquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del alquilcarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo acetilo, grupo propionilo, grupo butirilo, grupo isobutirilo, grupo valerilo, grupo isovalerilo, grupo 2-metilbutanoilo, grupo pivaloílo, grupo hexanoílo, grupo heptanoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de haloalquilcarbonilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo haloalquil-C(O)- en el cual este haloalquilo es el grupo haloalquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del haloalquilo C_{a-b} pueden incluir grupo fluoroacetilo, grupo cloroacetilo, grupo difluoroacetilo, grupo dicloroacetilo, grupo trifluoroacetilo, grupo clorodifluoroacetilo, grupo bromodifluoroacetilo, grupo tricloroacetilo, grupo pentafluoropropionilo, grupo heptafluorobutanoilo, grupo 3-cloro-2,2-dimetilpropanoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de cicloalquilarbonilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo cicloalquil-C(O)- en el cual este cicloalquilo es el grupo cicloalquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del cicloalquilarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo ciclopropilcarbonilo, grupo 2-metilciclopropilcarbonilo, grupo ciclobutilcarbonilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de cicloalquilarbonilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo halocicloalquil-C(O)- en el cual este halocicloalquilo es el grupo halocicloalquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del cicloalquilarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo 2,2-diclorociclopropilcarbonilo, grupo 2,2-dicloro-1-metilciclopropilcarbonilo y similares.

Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de C_{a-b} alcoxicarbonilo en esta especificación es un grupo alquil-O-C(O)- en el cual este alquilo es el grupo alquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del alcoxicarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo metoxicarbonilo, grupo etoxicarbonilo, grupo n-propiloxicarbonilo, grupo i-propiloxicarbonilo, grupo n-butoxicarbonilo, grupo i-butoxicarbonilo, grupo terc-butoxicarbonilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de haloalcoxicarbonilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo haloalquil-O-C(O)- en el cual este haloalquilo es el grupo haloalquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del haloalcoxicarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo clorometoxicarbonilo, grupo 2-cloroetoxicarbonilo, grupo 2,2-difluoroetoxicarbonilo, 2,2,2-trifluoroetoxicarbonilo, grupo 2,2,2-tricloroetoxicarbonilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de alquilaminocarbonilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo carbamoilo en el cual un átomo de hidrogeno es sustituido con el grupo alquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del alquilaminocarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo metilcarbamoilo, grupo etilcarbamoilo, grupo n-propilcarbamoilo, grupo i-propilcarbamoilo, grupo n-butilcarbamoilo, grupo i-butilcarbamoilo, grupo s-butilcarbamoilo, grupo terc-butilcarbamoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de haloalquilaminocarbonilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo carbamoilo en el que un átomo de hidrógeno está sustituido con el grupo haloalquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del haloalquilaminocarbonilo C_{a-b} pueden incluir grupo 2-fluoroetilcarbamoilo, grupo 2-cloroetilcarbamoilo, grupo 2,2-difluoroetilcarbamoilo, grupo 2,2,2-trifluoroetilcarbamoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de di(alquilo C_{a-b})aminocarbonilo en esta especificación es un grupo carbamoilo en el cual ambos átomos de hidrógeno son sustituidos por los grupos alquilo anteriores, que son iguales o diferentes entre si, que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del di(alquilo C_{a-b})aminocarbonilo puede incluir grupo N,N-dimetilcarbamoílo, grupo

N-etil-N-metilcarbamoílo, grupo N, N-dietilcarbamoilo, grupo N, N-di(n-propil)carbamoilo, grupo N ,N-di(n-butil)carbamoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de alquilaminosulfonilo C_{a-b} en esta especificación es un grupo sulfamoilo en el cual un átomo de hidrogeno es sustituido por el grupo alquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del alquilaminosulfonilo C_{a-b} pueden incluir grupo metilsulfamoilo, grupo etilsulfamoilo, grupo n-propilsulfamoilo, grupo i-propilsulfamoilo, grupo n-butilsulfamoilo, grupo i-butilsulfamoilo, grupo s-butilsufamoilo, grupo terc-butilsulfamoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de di(alquilo Ca-b)aminosulfonilo en esta especificación es un grupo sulfamoilo en el cual ambos átomos de hidrógeno son sustituidos por los grupos alquilo anteriores, que son iguales o diferentes entre si, que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del di(alquilo Ca-b)aminosulfamoilo puede incluir grupo N,N-dimetilsulfamoilo, grupo N-etil-N-metilsulfamoilo, grupo N, N-dietilsulfamoilo, grupo N, N-di(n-propil)sulfamoilo, grupo N ,N-di(n-butil)sulfamoilo y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de alquilamino C_{a-b} en esta especificación es un grupo amino en el cual un átomo de hidrogeno es sustituido por el grupo alquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del alquilamino C_{a-b} pueden incluir grupo metilamino, grupo etilamino, grupo n-propilamino, grupo i-propilamino, grupo n-butilamino, grupo i-butilamino, grupo s-butilamino, grupo terc-butilamino y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de di(alquilo C_{a-b})amino en esta especificación es un grupo amino en el cual ambos átomos de hidrógeno son sustituidos por los grupos alquilo anteriores, que son iguales o diferentes entre si, que tiene un número de átomos de carbono entre a y b. Ejemplos específicos del di(alquilo Ca-b)amino puede incluir grupo dimetilamino, grupo etil(metil)amino, grupo dietilamino, grupo n-propil(metil)amino, grupo i-propil(metil)amino, grupo di(n-propil)amino, grupo di(n-butil)amino y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de alquilo (C_{a-b}) opcionalmente sustituido por R^6, alquilo (C_{a-b}) opcionalmente

sustituido con R^{27}, alquilo(C_{a-b}) opcionalmente sustituido con R^{34}, alquilo(C_{a-b}) opcionalmente sustituido con R^{35}, o alquilo(C_{a-b}) opcionalmente sustituido con R^{36} en esta especificación es el grupo alquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b en los que los átomos de hidrógeno unidos a los átomos de carbono son opcionalmente sustituidos por cualquier R^6, R^{27}, R^{34}, R^{35} o R^{36}. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono. En este caso, cuando dos o más de los sustituyentes R^6, R^{27}, R^{34}, R^{35}, o R^{36} están contenidos en el grupo alquilo (C_{a-b}), R^6, R^{27}, R^{34}, R^{35}, o R^{36} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí.

La expresión de cicloalquilo (C_{a-b}) opcionalmente sustituido con R^6 o cicloalquilo (C_{a-b}) opcionalmente sustituido con R^{27} en esta especificación es el grupo cicloalquilo anterior que tiene un número de átomos de carbono entre a y b en el cual los átomos de hidrógeno unidos a los átomos de carbono son opcionalmente sustituidos por cualquier R^6 o $R^{27.}$ Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono. En este caso, cuando dos o más de los sustituyentes R^6 o R^{27} están contenidos en el grupo cicloalquilo (Ca-b), R_6 o R^{27} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí. Las posiciones sustituidas pueden estar en una parte de la estructura del anillo, en una parte de la estructura de cadena secundaria, o en ambas.

Ejemplos específicos de la expresión de "R^{11} forman opcionalmente un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R^{11} y R^{12} estan unidos formando una cadena de alquileno C_{2-6} junto con $R^{12,}$ y en este caso, la cadena de alquileno opcionalmente contiene un átomo de O, S, S(O), $S(O)_{2,}$ o N(R^{33}) y está opcionalmente sustituido con un grupo oxo o un grupo tioxo ", formas opcionalmente "R^{11a} un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al que R^{11a} y R^{12a} están unidos formando una cadena de alquileno C_{2-6} junto con $R^{12a,}$ y en este caso, la cadena de alquileno contiene opcionalmente uno O, S, S(O), $S(O)_{2,}$ o N(R^{33}) y está opcionalmente sustituido con un grupo oxo o un grupo tioxo ", y "R^{21} forman opcionalmente un anillo de 3-7 miembros junto con un átomo de nitrógeno al los cuales R^{21} y R^{22} están unidos formando una cadena de alquileno $_C$ 2-6 junto con $R^{22,}$ en este caso, la cadena de alquileno contiene opcionalmente uno O, S, S (O), S (O) $_{2,}$ o N ($R^{39)}$ y está opcionalmente sustituido con un grupo oxo o un grupo tioxo "en esta especificación puede incluir aziridina, azetidina, azetidin-2-ona, pirrolidin, pirrolidin-2-ona, oxazolidina, oxazolidin-2-ona, oxazolidin-2 tiona, tiazolidina, tiazolidin-2-ona, tiazolidin-2-tiona, imidazolidina, imidazolidin-2-ona, imidazolidin-2-tiona, piperidina, piperidin-2-ona, piperidin-2-tiona, 2H-3,4 , 5,6-tetrahidro-1,3-oxazin-2-ona, 2H-

3,4,5,6-tetrahidro-1,3-oxazina-2-tiona, morfolina, 2H-3,4,5,6 tetrahidro-1,3-tiazin-2-ona, 2H-3,4,5,6-tetrahidro-1,3-tiazin-2-tiona, tiomorfolina, tiomorfolina-1-óxido, tiomorfolina-1,1-dióxido de , perhydropyrimidin-2-ona, piperazina, homopiperidina, homopiperidin-2-ona, heptametilenimina y similares. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

La expresión de (alcoxi C_{a-b}) alquilo C_{d-e}, (alquiltio C_{a-b}) alquilo C_{d-e}, o similar, en esta especifica es un grupo hidrocarburo lineal o ramificado que tiene un número de átomos de carbono entre d y e o en la que el átomo de hidrógeno unido al átomo de carbono es opcionalmente sustituido por cualquier grupo alcoxilo C_{a-b} o grupo alquiltio C_{a-b} anterior respectivamente. Cada uno de estos grupos se selecciona en un intervalo del número especificado de átomos de carbono.

El "heterociclo aromático de 5-6 miembros" en esta especificación significa un heterociclo aromático monocíclico en el cual el número de átomos que forman el anillo es de 5 a 6 y 1 a 5 heteroátomos (el heteroátomo se refiere a un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno o un átomo de azufre) se encuentran en los átomos que forman el anillo. Ejemplos específicos del heterociclo aromático de 5-6 miembros pueden incluir pirrol, pirazol, imidazol, triazol, tetrazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, triazina, furano, tiofeno, tiazol, isotiazol, oxazol, isoxazol, oxadiazol, tiadiazol y similares.

Cuando el "heterociclo aromático de 5-6 miembros" contiene un enlace doble C=N, el átomo de nitrógeno puede ser N-óxido.

El "heteroarilo de 5-6 miembros" en esta especificación significa un sustituyente monovalente formado al eliminar un átomo de hidrógeno de cualquier posición en el anterior " heterociclo aromático de 5-6 miembros". Las posiciones a las que estos sustituyentes estan unidos no están limitadas en particular, y los sustituyentes pueden estar unidos a las posiciones deseadas.

El "heterociclo no aromático de 3-7 miembros" en esta especificación se refiere a un heterociclo no aromático monocíclico que tiene las siguientes características:

1) el número de átomos que forman el anillo es de 3 a 7,

2) 1 a 3 heteroátomos (el heteroátomo se refiere a un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno, o un átomo de azufre) están contenidos en los átomos que forman el anillo,

3) un grupo carbonilo, un grupo tiocarbonilo, un enlace doble, o un enlace triple pueden estar contenidos en el anillo, y

4) cuando un átomo de azufre está contenido en los átomos que forman el anillo, el átomo de

azufre puede ser un grupo sulfinilo o un grupo sulfonilo.

Ejemplos específicos del heterociclo no aromático de 3-7 miembros pueden incluir azetidina, pirrolidina, pirrolidinona, oxazolidina, isoxazolidina, tiazolidina, isotiazolidina, piperazina, piperazinona, piperidina, piperidinona, morfolina, tiomorfolina, azepina, diazepina, oxetano, tetrahidrofurano, 1,3-dioxolano, tetrahidropirano, 1,4-dioxano, oxepano, homomorfolina y similares.

El "heterociclilo de 3-7 miembros" en esta especificación significa un sustituyente monovalente formado al eliminar un átomo de hidrógeno de cualquier posición en el anterior "heterociclo no aromático de 3-7 miembros". Las posiciones a las que estos sustituyentes estan unidos no están limitadas en particular, y los sustituyentes pueden estar unidos a las posiciones deseadas.

El "heteroarilo de 5-6 miembros opcionalmente sustituido por R^{28} y $R^{28a"}$ en esta especificación es un "heteroarilo de 5-6 miembros" en el cual los átomos de hidrógeno sobre los átomos de carbono que forman el anillo del "heteroarilo de 5- 6 miembros" están sustituidos en los átomos de carbono por cualquier R^{28} en un rango del número de los átomos de hidrógeno existentes. En este caso, cuando existe nitrógeno entre los átomos que forman el anillo del "heteroarilo de 5-6 miembros" y el átomo de nitrógeno potencialmente tiene una estructura NH, el "heteroarilo de 5-6 miembros opcionalmente sustituido por R^{28} y $R^{28a"}$ es un "heteroarilo de 5-6 miembros" en el cual el átomo de hidrógeno sobre el átomo de nitrógeno está opcionalmente sustituido por cualquier R^{28a} en un rango del número de átomos de hidrógeno existentes. En este caso, cuando existen dos o más sustituyentes R^{28} en los átomos de carbono que forman el anillo del "heteroarilo de 5-6 miembros" y dos o más sustituyentes R^{28a} sustituidos por el átomo de nitrógeno que tiene una estructura potencialmente NH que forma el anillo independientemente, dos o más de R^{28} y R^{28a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí, y cuando dos R^{28} son adyacentes, los dos R^{28} adyacentes forman opcionalmente un anillo de 6 miembros junto con los átomos de carbono a los que cada R^{28} está unido formando -CH = CH-CH = CH-.

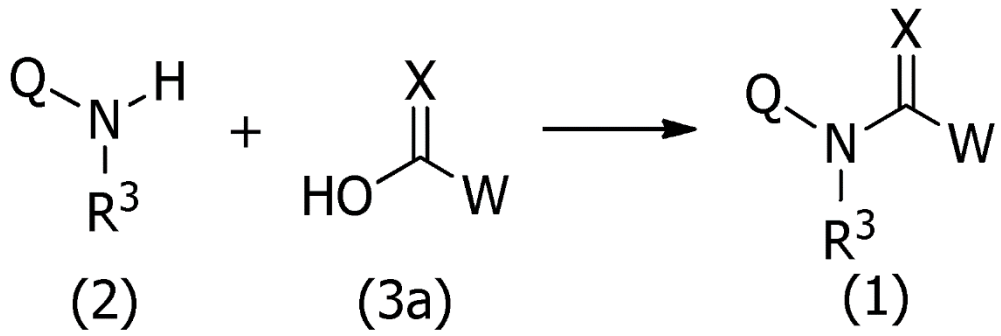
El "heterociclilo de 3-7 miembros opcionalmente sustituido por R^{28} y $R^{28a"}$ en esta especificación es un "heterociclilo de 3-7 miembros" en el cual los átomos de hidrógeno sobre los átomos de carbono que forman el anillo del "heterociclililo de 3-7 miembros" son sustituidos en los átomos de carbono por cualquier R^{28} en un rango del número de los átomos de hidrógeno existentes. En este caso, cuando existe nitrógeno entre los átomos que forman el anillo del

"heterociclilo de 3-7 miembros" y el átomo de nitrógeno potencialmente tiene una estructura NH, el "heterociclilo de 3-7 miembros opcionalmente sustituido por R^{28a}" es un "heteroarilo de 3-7 miembros" en el cual el átomo de hidrógeno sobre el átomo de nitrógeno está opcionalmente sustituido por cualquier R^{28a} en un rango del número de átomos de hidrógeno existentes. En este caso, cuando existen dos o más sustituyentes R^{28} en los átomos de carbono que forman el anillo del "heterociclilo de 3-7 miembros" y dos o más sustituyentes R^{28a} sustituidos por el átomo de nitrógeno que tiene una estructura potencialmente NH que forma el anillo independientemente, dos o más de R^{28} y R^{28a} son opcionalmente iguales o diferentes entre sí, y cuando dos R^{28} son adyacentes, los dos R^{28} adyacentes forman opcionalmente un anillo de 6 miembros junto con los átomos de carbono a los que cada R^{28} está unido formando -CH = CH-CH = CH-.

A continuación, se describirá el método de producción del compuesto de la presente invención.

Método de producción A

El compuesto de amida heterocíclica de la fórmula (1) se puede producir mediante, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto de Fórmula (2) con el compuesto de fórmula (3a).



(2) (3a) (1)

El compuesto de fórmula (1): [donde Q y R^3, W, y X tienen el mismo significado como se definio anteriormente] de la presente invención puede ser producido haciendo reaccionar el compuesto de Fórmula (2): [donde Q y R^3, tienen el mismo significado como se definió anteriormente] o la sal del mismo con el compuesto de Fórmula (3a): [donde W y X tienen el mismo significado como se definió anteriormente] o la sal del mismo en un solvente o sin usar un solvente mediante el uso de una base, un agente de condensación, y/o un catalizador si es necesario y añadiendo un aditivo si es necesario.

En esta reacción, el compuesto de la fórmula (3a) se puede utilizar en una rango de 0.1 a

100 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de Fórmula (2).

Cuando se utiliza el solvente, el solvente a utilizar puede ser un solvente que es inactivo a la reacción. Ejemplos del solvente pueden incluir solventes polares tales como N, N-dimetilformamida, N, N-dimetilacetamida, acetonitrilo, dimetilsulfóxido, y 1,3-dimetil-2-imidazolinona; éteres tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, y éter de difenilo; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono y 1,2-dicloroetano; e hidrocarburos alifáticos tales como n-pentano y n-hexano. Estos solventes se pueden utilizar solos o en combinaciones de dos o más de ellos.

Cuando se utiliza la base, ejemplos de la base a utilizar puede incluir bases orgánicas tales como trietilamina, piridina, y 4-(dimetilamino)piridina y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio y carbonato de sodio. Estas bases se pueden utilizar en una rango de 0.1 a 50 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de Fórmula (2).

Cuando se usa el agente de condensación, ejemplos del agente de condensación a utilizar pueden incluir 1H-benzotriazol-1-iloxitris(dimetilamino)fosfonio, N, N'-diciclohexilcarbodiimida, 1- (3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida, y yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio. Estos agentes de condensación se pueden utilizar en un rango de 0.1 a 50 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de Fórmula (2).

Cuando se utiliza el aditivo, ejemplos del aditivo a utilizar puede incluir 3H-[1,2,3] triazolo [4,5-b]piridina-3-ol y 1-hidroxibenzotriazol. Estos aditivos se pueden utilizar en un rango de 0.1 a 50 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de Fórmula (2).

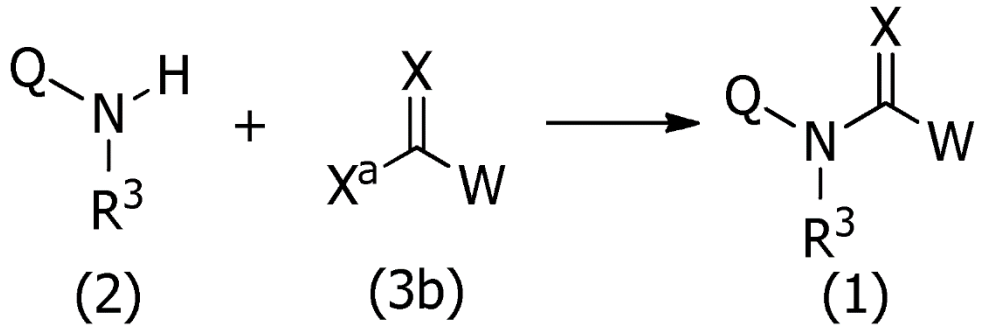
Como temperatura de reacción, se puede ajustar cualquier temperatura de -78 ° C a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la concentración del sustrato de reacción y la temperatura de reacción, por lo general se puede establecer cualquier tiempo en un intervalo de 5 minutos a 100 horas.

Algunos de los compuestos de Fórmula (2) son compuestos conocidos y algunos de los compuestos están disponibles comercialmente.

Algunos de los compuestos de fórmula (3a) son compuestos conocidos y se pueden sintetizar de acuerdo con métodos conocidos descritos en los documentos. Ejemplos de los métodos conocidos en los documentos pueden incluir un método descrito en el documento WO 2008/006540.

Método de producción B

El compuesto de amida heterocíclica de la fórmula (1) se puede producir mediante, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto de Fórmula (2) con el compuesto de fórmula (3b).



(2) (3b) (1)

El compuesto de fórmula (1): [donde Q y R^3, W, y X tienen el mismo significado como se definió anteriormente] de la presente invención puede ser producido haciendo reaccionar el compuesto de Fórmula (2): [donde Q y R^3, tienen el mismo significado como se definió anteriormente] o la sal del mismo con el compuesto de Fórmula (3b): [donde W y X tienen el mismo significado como se definió anteriormente y X^a es un grupo saliente tal como un átomo de halógeno] o la sal del mismo en un solvente o sin usar un solvente mediante el uso de una base si es necesario.

En esta reacción, el compuesto de la fórmula (3b) se puede utilizar en un rango de 0.1 a 100 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de Fórmula (2).

Cuando se utiliza el solvente, el solvente a utilizar puede ser un solvente que es inactivo a la reacción. Ejemplos del solvente pueden incluir solventes polares tales como N, N-dimetilformamida, N, N-dimetilacetamida, acetonitrilo, dimetilsulfóxido, y 1,3-dimetil-2-imidazolinona; éteres tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, y éter de difenilo; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono y 1,2-dicloroetano; e hidrocarburos alifáticos tales como n-pentano y n-hexano. Estos solventes se pueden utilizar solos o en combinaciones de dos o más de ellos.

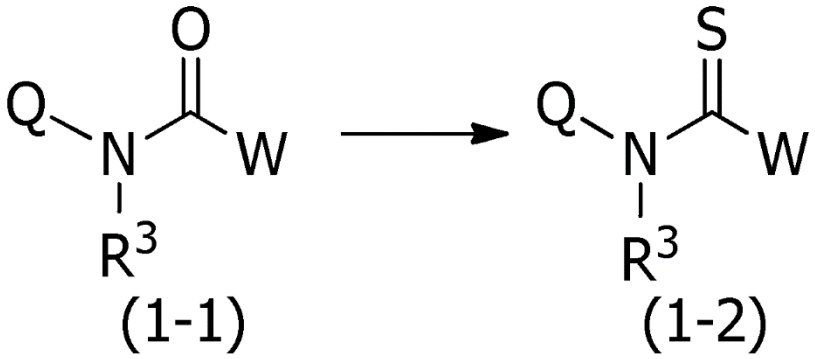
Cuando se utiliza la base, ejemplos de la base a utilizar puede incluir bases orgánicas tales como trietilamina, piridina, y 4-(dimetilamino)piridina y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, carbonato de sodio, hidrogencarbonato de potasio, hidrogencarbonato de sodio, e

hidruro de sodio. Estas bases se pueden utilizar en una rango de 0.1 a 50 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de Fórmula (2). Estas bases se pueden utilizar solas o en combinaciones de dos o más de ellos.

Como temperatura de reacción, se puede ajustar cualquier temperatura de -78 °C a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la concentración del sustrato de reacción y la temperatura de reacción, por lo general se puede establecer cualquier tiempo en un intervalo de 5 minutos a 100 horas.

Método de producción C

El compuesto de la Fórmula (1-2): [donde W, Q y R^3, tienen el mismo significado como se definio anteriormente] de la presente invención pueden ser producidos, por ejemplo, por la reacción del compuesto de la Fórmula (1-1): [donde W, Q y R^3 tienen el mismo significado como se definio anteriormente] de la presente invención con agentes sulforizantes tales como pentasulfuro de fósforo, pentasulfuro de fósforo-HMDO (hexametildisiloxano), y reactivo de Lawesson (2,4-bis (4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiadifosfetano-2,4-disulfuro).



El agente sulforizante utilizado en esta reacción se puede utilizar en un rango de 0.5 a 50 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de la Fórmula (1-1).

Bases tales como carbonato de potasio, trietilamina, piridina, y 4-(dimetilamino)piridina se pueden utilizar si es necesario.

Esta reacción puede llevarse a cabo sin utilizar un solvente. Sin embargo, un solvente puede ser utilizado. Ejemplos del solvente pueden incluir solventes polares tales como N, N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, acetonitrilo, dimetilsulfóxido, 1,3-dimetil-2-imidazolinona, y agua; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, 2-propanol, y glicol de

etileno; éteres tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, y éter de difenilo; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; e hidrocarburos alifáticos tales como pentano y n-hexano. Estos solventes se pueden utilizar solos o en combinaciones de dos o más de ellos.

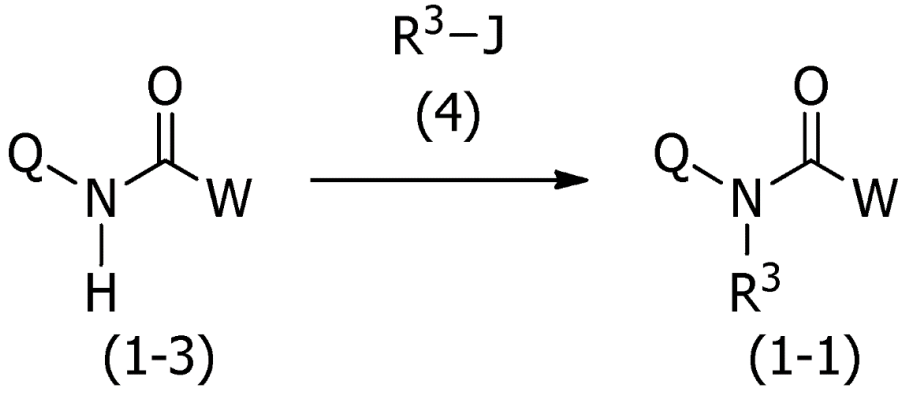
Como temperatura de reacción, se puede ajustar cualquier temperatura de -60 ° C a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la concentración del sustrato de reacción y la temperatura de reacción, por lo general se puede establecer cualquier tiempo en un intervalo de 5 minutos a 100 horas.

En el método de producción A al método de producción C, el tratamiento usual posterior de la mezcla de reacción después de la finalización de la reacción tales como la concentración directa, la concentración después de disolver en un disolvente orgánico y el lavado con agua, o la concentración después de verter en hielo agua y extracción con un disolvente orgánico pueden dar el compuesto de la presente invención. Cuando se requiere purificación, el compuesto se puede separar y purificar mediante cualquier método de purificación tal como recristalización, cromatografía en columna, cromatografía de capa delgada, y cromatografía líquida.

Algunos de los compuestos de la fórmula (3b) se pueden sintetizar de acuerdo con la fórmula 1 de reacción descrita a continuación.

Método de producción D

El compuesto de amida heterocíclica de la fórmula (1-1) se puede producir mediante, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto de Fórmula (1-3): [donde W y Q, tienen el mismo significado como se definio anteriormente] con el compuesto de Fórmula (4): [donde R^3 tienen el mismo significado como se definio anteriormente y J es un grupo saliente tal como un átomo de halógeno, -OH, $-OSO_2$ Me, y $-OSO_2$ CF_3].



En esta reacción, el compuesto de la fórmula (4) se puede utilizar en un rango de 0.5 a 50 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de Fórmula (1-3). Ácidos tales como ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, y ácido p-toluenosulfónico o bases tales como carbonato de potasio, trietilamina, piridina, y 4-(dimetilamino)piridina, hidruro de sodio, hidróxido de sodio, y hidróxido de potasio se pueden utilizar si es necesario. Alternativamente, se puede utilizar la reacción de Mitsunobu usando azodicarboxilato de dietilo, trifenilfosfina, y similares.

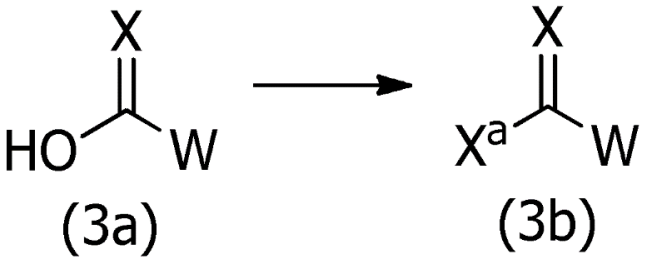
Esta reacción puede llevarse a cabo sin utilizar un solvente. Sin embargo, un solvente puede ser utilizado. Ejemplos del solvente pueden incluir solventes polares tales como N, N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, acetonitrilo, dimetilsulfóxido, 1,3-dimetil-2-imidazolinona, y agua; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, 2-propanol, y glicol de etileno; éteres tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, y éter de difenilo; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; e hidrocarburos alifáticos tales como pentano y n-hexano. Estos solventes se pueden utilizar solos o en combinaciones de dos o más de ellos.

Como temperatura de reacción, se puede ajustar cualquier temperatura de -60 °C a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la concentración del sustrato de reacción y la temperatura de reacción, por lo general se puede establecer cualquier tiempo en un intervalo de 5 minutos a 100 horas.

Algunos de los compuestos de Fórmula (4) son compuestos conocidos y algunos de los compuestos están disponibles comercialmente. Los compuestos distintos de los compuestos descritos anteriormente se pueden sintetizar de acuerdo con métodos descritos en los documentos de referencia.

Fórmula de Reacción 1

El compuesto de la fórmula (3b) se puede producir mediante, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto de Fórmula (3a) con un agente de halogenación.



(3a) (3b)

El compuesto de fórmula (3b): [donde W, X y X^a tienen el mismo significado como se definio anteriormente] se puede producir haciendo reaccionar el compuesto de fórmula (3a) [en donde W y X tienen el mismo significado como se definió anteriormente] o la sal del mismo con el agente de halogenación en un solvente o sin ayuda de un solvente mediante el uso de una base si es necesario.

Ejemplos del agente de halogenación pueden incluir cloruro de tionilo, cloruro de oxalilo, y cloruro de fosforilo. El agente de halogenación se pueden utilizar en un rango de 0.1 a 100 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de Fórmula (3a).

Cuando se utiliza el solvente, el solvente a utilizar puede ser un solvente que es inactivo a la reacción. Ejemplos del solvente pueden incluir solventes polares tales como N, N-dimetilformamida, N, N-dimetilacetamida, acetonitrilo, dimetilsulfóxido, y 1,3-dimetil-2-imidazolinona; éteres tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, y éter de difenilo; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono y 1,2-dicloroetano; e hidrocarburos alifáticos tales como n-pentano y n-hexano. Estos solventes se pueden utilizar solos o en combinaciones de dos o más de ellos.

Cuando se utiliza la base, ejemplos de la base a utilizar puede incluir bases orgánicas tales como trietilamina, piridina, y 4-(dimetilamino)piridina y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, carbonato de sodio, hidrogencarbonato de potasio, hidrogencarbonato de sodio, e hidruro de sodio. Estas bases se pueden utilizar en una rango de 0.1 a 50 equivalentes con respecto a 1 equivalente del compuesto de Fórmula (3a). Estas bases se pueden utilizar solas o en combinaciones de dos o más de ellos.

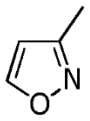
Como temperatura de reacción, se puede ajustar cualquier temperatura de -78 ° C a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la concentración del sustrato de reacción y la temperatura de reacción, por lo general se puede establecer cualquier tiempo en un intervalo de 5 minutos a 100 horas.

El tratamiento posterior habitual para la mezcla de reacción después de la finalización de la reacción puede proporcionar un intermedio de producción como un compuesto material de partida para el método de producción B.

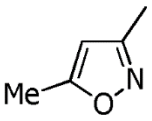
El intermedio de producción producido por este método se puede utilizar en la siguiente etapa sin aislamiento y purificación.

Ejemplos específicos del compuesto activo incluidos en la presente invención pueden incluir los compuestos indicados en la Primera tabla a Tercera Tabla. Los compuestos listados en la Primera Tabla a Tercera tabla, sin embargo, son compuestos para ejemplificación, y por lo tanto la presente invención no se limita a estos compuestos. En las tablas, el sustituyente descrito como Me es un grupo metilo. Del mismo modo en las Tablas, Et es grupo etilo, n-Pr y Pr-n son cada uno grupo normal-propilo, i-Pr y Pr-i son cada uno grupo iso-propilo, c-Pr y Pr-c son cada uno grupo ciclopropilo, n Bu y Bu-n son cada uno grupo normal-butilo, s-Bu y Bu-s son cada uno grupo secundario-butilo, un i-Bu y Bu-i son cada uno grupo iso-butilo, t-Bu-t Bu y son cada uno grupo butilo terciario, c-Bu y Bu-c son cada uno grupo ciclobutilo, n-Pen y Pen-n son cada uno grupo normal-pentilo, i-Pen y Pen-i son cada uno grupo iso-pentilo, S-Pen y Pen-s son cada uno grupo secundario-pentilo, t-Pen y Pen-t son cada uno grupo terc-pentilo, c-Pen y Pen-c son cada uno grupo ciclopentilo, 3-Pen es grupo $-CH(Et)_2$, n- Hex y Hex-n son cada uno grupo normal-hexilo, c-Hex y Hex-c son cada uno ciclohexilo, y Ph es un grupo fenilo.

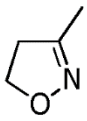
En las tablas, las estructuras de D-3, D-3a, D-4, D-4a, D-4b, D-8, D-8a, D-8b, D-8c, D-8d, D-8e, D-8f, D-8g, D-8h, D-9, D-9a, D-9b, D-9c, D-9d, D-9e, D-9f, D-9g, D-9h, D-9i, D-9j, D- 9k, D-9m, D-10a, D-11, D-12, D-13a, D-14, D-15, D-16, D-16a, D-16b, D-16c, D-16d, D-16e, D-16f, D-16g, D-16h, D-16i, D-16j, D-16k, D-16m, D-16n, D-16p, D-17, D-17a, D-17b, D-18, D-19, D-21, D-24a, D-24b, D-24c, D-24d, D-24e y D-24f son las siguientes:



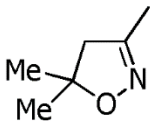
D-3



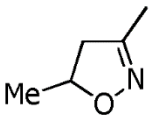
D-3a



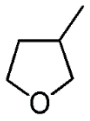
D-4



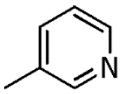
D-4a



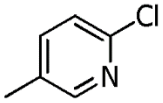
D-4b



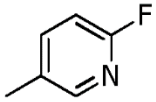
D-5



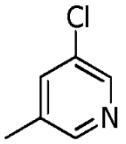
D-8



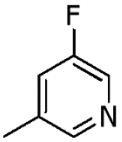
D-8a



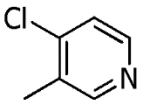
D-8b



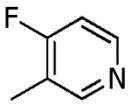
D-8c



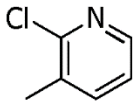
D-8d



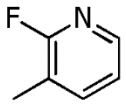
D-8e



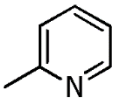
D-8f



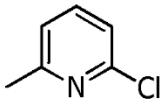
D-8g



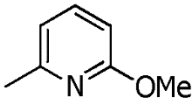
D-8h



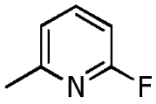
D-9



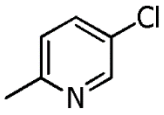
D-9a



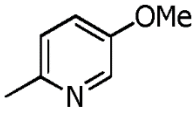
D-9b



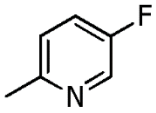
D-9c



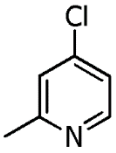
D-9d



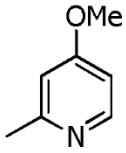
D-9e



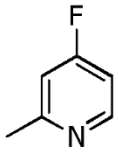
D-9f



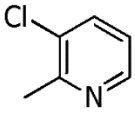
D-9g



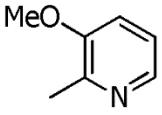
D-9h



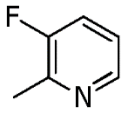
D-9i



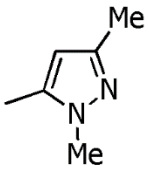
D-9j



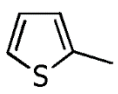
D-9k



D-9m

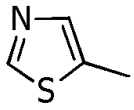


D-10a

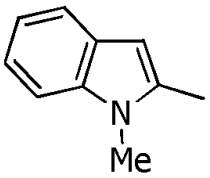


D-11

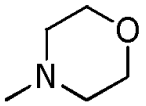
5



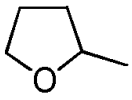
D-12



D-13a

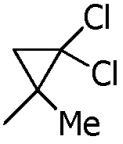


D-14

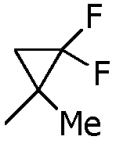


D-15

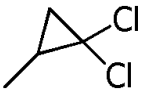
D-16



D-16a

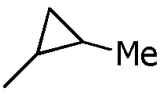


D-16b

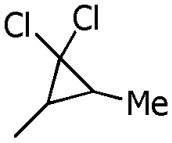


D-16c

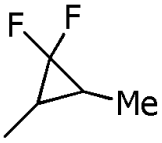
D-16d



D-16e

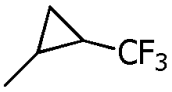


D-16f

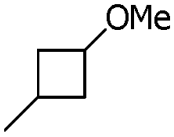


D-16g

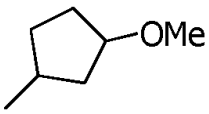
D-16h



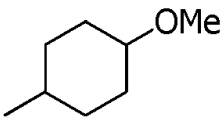
D-16i



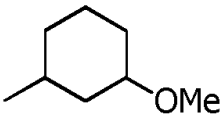
D-16j



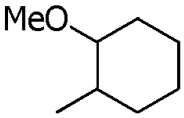
D-16k



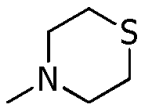
D-16m



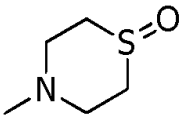
D-16n



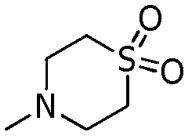
D-16p



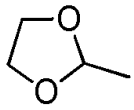
D-17



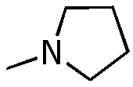
D-17a



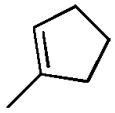
D-17b



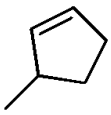
D-18



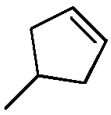
D-19



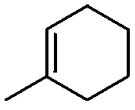
D-24a



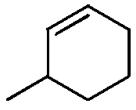
D-24b



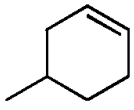
D-24c



D-24d



D-24e



D-24f

[0189] [Primera Tabla]