

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2007-527879

(P2007-527879A)

(43) 公表日 平成19年10月4日(2007.10.4)

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)	
<b>CO7D 401/14 (2006.01)</b>	CO7D 401/14	CSP	2B030
<b>AO1N 43/54 (2006.01)</b>	AO1N 43/54	C	2B121
<b>AO1P 13/02 (2006.01)</b>	AO1P 13/02		4C063
<b>CO7D 403/04 (2006.01)</b>	CO7D 403/04		4H011
<b>CO7D 405/14 (2006.01)</b>	CO7D 405/14		

審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全 57 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2007-502228 (P2007-502228)  
 (86) (22) 出願日 平成17年2月26日 (2005.2.26)  
 (85) 翻訳文提出日 平成18年10月24日 (2006.10.24)  
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2005/002049  
 (87) 国際公開番号 W02005/089551  
 (87) 国際公開日 平成17年9月29日 (2005.9.29)  
 (31) 優先権主張番号 102004011705.5  
 (32) 優先日 平成16年3月10日 (2004.3.10)  
 (33) 優先権主張国 ドイツ (DE)

(71) 出願人 500137954  
 バイエル クロップサイエンス ゲーエム  
 ベーハー  
 ドイツ連邦共和国デー65929フラン  
 クフルト、ブリュニングシュトラッセ50  
 (74) 代理人 100091731  
 弁理士 高木 千嘉  
 (74) 代理人 100127926  
 弁理士 結田 純次  
 (74) 代理人 100105290  
 弁理士 三輪 昭次  
 (72) 発明者 ミヒャエル・ゲーアハルト・ホフマン  
 ドイツ連邦共和国65439フレールスハ  
 イム、ヤーンシュトラッセ6a

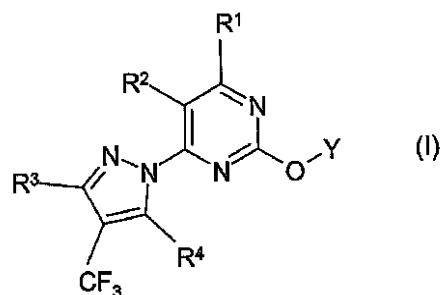
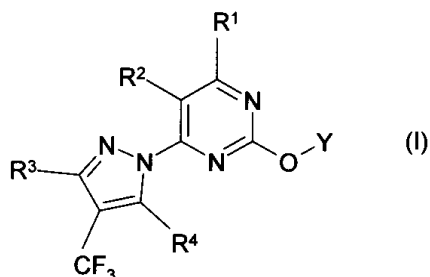
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 除草剤として有用な置換4-(4-トリフルオロメチルピラゾリル)ピリミジン類

(57) 【要約】

式(I)

【化1】



の4-(4-トリフルオロメチルピラゾリル)ピリミジン類及び除草剤としてのそれらの使用。

一般式(I)において、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は各種基であり、Yは芳香族基または複素環式芳香族基である。

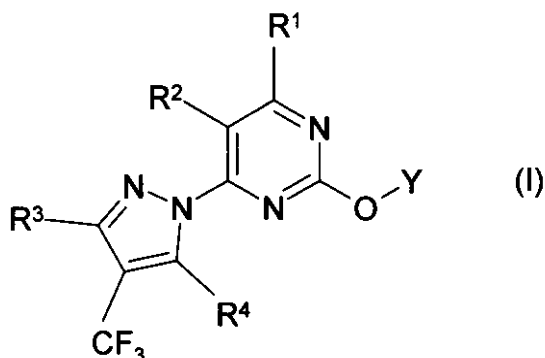
。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



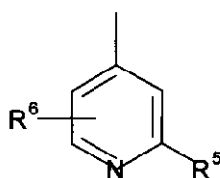
10

の化合物、その N - オキシドまたはその塩。

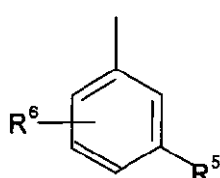
式中、

Y は次の Y 1 ~ Y 9 :

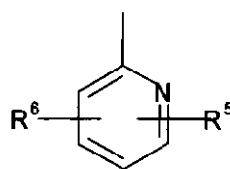
【化 2】



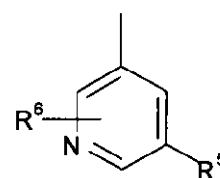
Y1



Y2

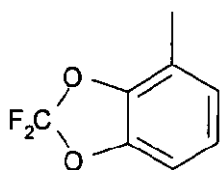


Y3

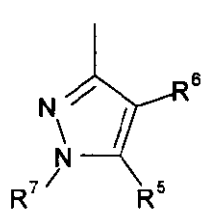


Y4

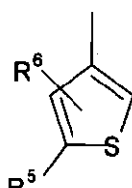
20



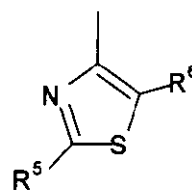
Y5



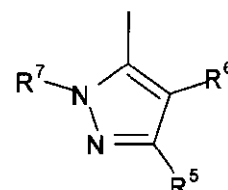
Y6



Y7



Y8



Y9

30

からなる群から選択される基であり、

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> は互いに独立して水素、ハロゲン、シアノ、イソシアネート、ヒドロキシル、COOR<sup>9</sup>、COR<sup>9</sup>、CH<sub>2</sub>OH、CH<sub>2</sub>SH、CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、NO<sub>2</sub>、CSNH<sub>2</sub>、CONH<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、ハロ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキシ、ハロ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) - アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>4</sub>) - アルケニルオキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキニルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - アルキルチオ - (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - アルキル、S(O)<sub>n</sub>R<sup>8</sup>、(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - アルキルスルホニル - (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - アルキル、アミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルスルホニルアミノ若しくはジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルアミノであり、または、

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> は一緒になって CH<sub>2</sub> - CH<sub>2</sub> - CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub> - CH<sub>2</sub> - CH<sub>2</sub> - CH<sub>2</sub> 若しくは OCH<sub>2</sub> - CH<sub>2</sub> - CH<sub>2</sub>O であり；

R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> は互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、ハロ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキシまたはハロ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキシであり；

40

50

R<sup>5</sup>はハロゲン、シアノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、ハロ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキシ、ハロ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキシ、ハロ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub>) - シクロアルキル、ハロ - (C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub>) - シクロアルキル、SF<sub>5</sub>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>8</sup>、(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) - アルケニルまたは(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキニルであり；

R<sup>6</sup>は水素、ハロゲン、シアノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、ハロ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキシ、ハロ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキシまたはS(O)<sub>n</sub>R<sup>8</sup>であり；

R<sup>7</sup>は(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルであり；

R<sup>8</sup>は水素、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルまたはハロ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルであり；

R<sup>9</sup>は水素または(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルであり；

nは0、1または2である。

10

【請求項2】

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が互いに独立して水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、ホルミル、ビニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、ハロ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル若しくは(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキシであり、または、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は一緒になってCH<sub>2</sub> - CH<sub>2</sub> - CH<sub>2</sub>であり；

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は互いに独立して、水素、ハロゲン、メチルまたはメトキシであり；そしてYが基Y<sub>1</sub>、Y<sub>2</sub>、Y<sub>3</sub>、Y<sub>6</sub>、Y<sub>7</sub>、Y<sub>8</sub>またはY<sub>9</sub>である

請求項1に記載された化合物。

【請求項3】

R<sup>1</sup>が水素、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、トリフルオロメチル、メトキシ、メチル若しくはエチルであり、

20

R<sup>2</sup>は水素、ヒドロキシル、メチル、エチル、メトキシ、若しくはエトキシであり、または、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は一緒になってCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>であり；そして

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は互いに独立して水素またはメチルである

請求項1または2に記載された化合物。

【請求項4】

R<sup>5</sup>がハロゲン、シアノ、ハロ - (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - アルキル、ハロ - (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - アルコキシまたはハロ - (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - アルキルチオである請求項1～3の何れかに記載の化合物。

【請求項5】

30

R<sup>2</sup>及びR<sup>6</sup>が各々水素であり、YがY<sub>1</sub>、Y<sub>2</sub>、Y<sub>7</sub>、Y<sub>8</sub>またはY<sub>9</sub>である請求項1～4の何れかに記載の化合物。

【請求項6】

請求項1～5の何れかに記載された一般式(I)の少なくとも1つの化合物の除草有効量を含む除草剤組成物。

【請求項7】

処方助剤との混合物である請求項6に記載された除草剤組成物。

【請求項8】

請求項1～5の何れかに記載された一般式(I)の少なくとも1つの化合物または請求項6若しくは7に記載された除草剤組成物の少なくとも1つの化合物の有効量を不要な植物若しくは不要な植物の生長場所へ適用することを含む、不要な植物を防除する方法。

40

【請求項9】

不要な植物を防除するために、請求項1～5の何れかに記載された一般式(I)の化合物または請求項6または7に記載された除草剤組成物の使用。

【請求項10】

一般式(I)の化合物を有用な植物の集団中の不要な植物を防除するために使用する請求項9に記載の使用。

【請求項11】

有用な植物が遺伝子導入の有用植物である請求項10に記載の使用。

【発明の詳細な説明】

50

## 【技術分野】

## 【0001】

本発明は除草剤の技術分野に関し、特に有用な植物の集団中における広葉雑草及び雑草類を選択的に防除するためのヘテロアリアルピラゾールからの除草剤の技術分野に関する。

## 【背景技術】

## 【0002】

多くの刊行物から、例えばピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリルの様なアゾール基により置換されたある種のピリジン類及びピリミジン類が除草特性を有していることが既に知られている。例えば、W099/28301は2-位にアゾール基及び4-位または6-位に炭素原子を介して接続する芳香族基または複素環式芳香族基を有するピリジン類及びピリミジン類を開示している。W098/40379は2-位にアゾール基及び4-位または6-位に酸素、窒素若しくは硫黄原子を介して接続する芳香族基または複素環式芳香族基を有するピリジン類及びピリミジン類を記載している。2-位のアゾール基は種々の基により置換することができる。この刊行物はピラゾリル基の種々の置換基を開示しており、それらは各場合において3-位に位置している。ACS Symposium Series (2002)、800 (Synthesis and Chemistry of Agrochemicals) 76頁には除草剤としては有効ではない4-位にアゾール基を有するピリミジン類を開示している。これらの化合物は上記刊行物から公知であるピリミジン化合物の位置異性体である。

10

## 【発明の開示】

20

## 【発明が解決しようとする課題】

## 【0003】

しかしながら、上記刊行物から公知である化合物は不十分ではあるが、しばしば除草活性を示す。従って、これら先行技術の化合物を超える改良された除草特性を有する除草に有効な化合物を提供することが本発明の一つの目的である。

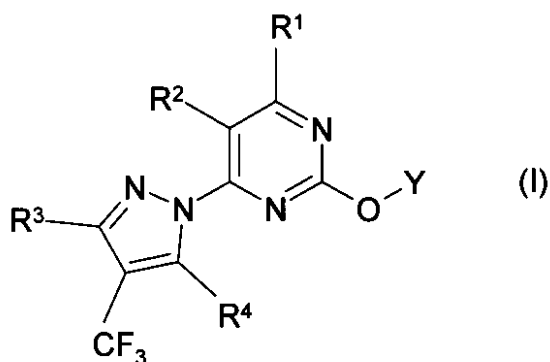
## 【課題を解決するための手段】

## 【0004】

ある種の4-(4-トリフルオロメチルピラゾリル)ピリミジン類が特に好適な除草剤であることをこの度発見した。従って、本発明は式(I)の化合物、それらのN-オキシド及びそれらの塩を提供するものである。

30

## 【化1】

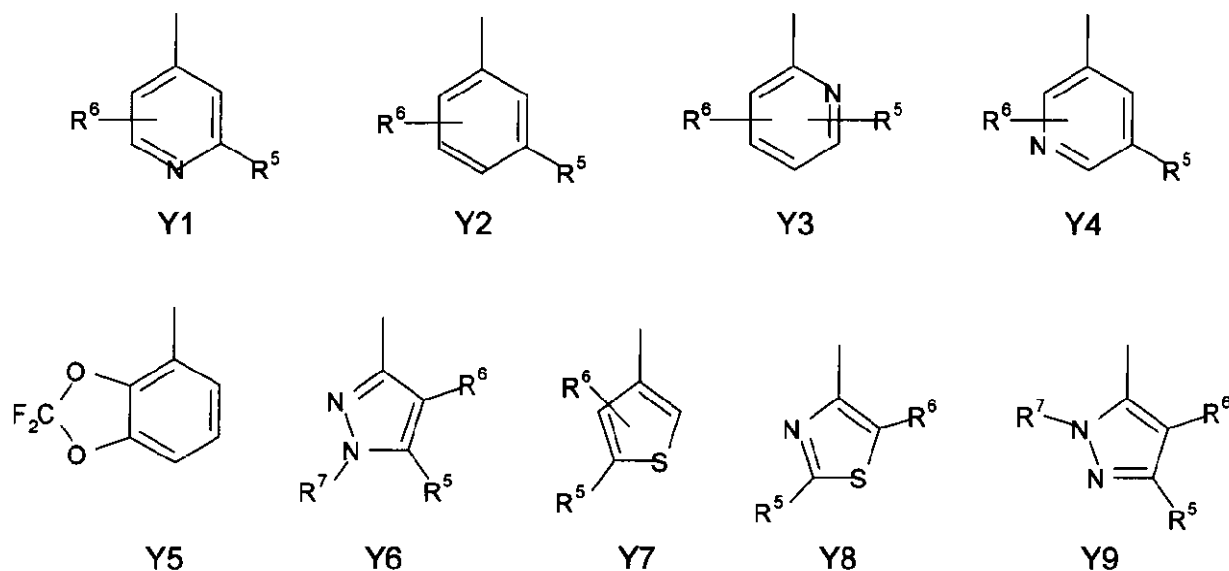


40

ここで、基及び記号は以下の意味を有する：

YはY1～Y9からなる群から選択される基である：

## 【化2】



10

## 【0005】

$R^1$  及び  $R^2$  は互いに独立して水素、ハロゲン、シアノ、イソシアネート、OH、 $\text{COOR}^9$ 、 $\text{COR}^9$ 、 $\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $\text{CH}_2\text{SH}$ 、 $\text{CH}_2\text{NH}_2$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{CSNH}_2$ 、 $\text{CONH}_2$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキル、ハロ- $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ -シクロアルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルコキシ、ハロ- $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルコキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_2)$ -アルコキシ- $(\text{C}_1 - \text{C}_2)$ -アルキル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_4)$ -アルケニル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_4)$ -アルキニル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_4)$ -アルケニルオキシ、 $(\text{C}_3 - \text{C}_4)$ -アルキニルオキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_2)$ -アルキルチオ- $(\text{C}_1 - \text{C}_2)$ -アルキル、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^8$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_2)$ -アルキルスルホニル- $(\text{C}_1 - \text{C}_2)$ -アルキル、アミノ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキルアミノ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$ アルキルカルボニルアミノ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ アルキルスルホニルアミノ若しくはジ- $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキルアミノであり、

20

または

$R^1$  及び  $R^2$  は一緒になって  $\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH}_2$  若しくは  $\text{OCH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH}_2\text{O}$  であり、

30

$R^3$  及び  $R^4$  は互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキル、ハロ- $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルコキシまたはハロ- $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルコキシであり、

$R^5$  はハロゲン、シアノ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキル、ハロ- $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルコキシ、ハロ- $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルコキシ、ハロ- $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキルチオ、 $(\text{C}_3 - \text{C}_5)$ -シクロアルキル、ハロ- $(\text{C}_3 - \text{C}_5)$ -シクロアルキル、 $\text{SF}_5$ 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^8$ 、 $(\text{C}_2 - \text{C}_4)$ -アルケニルまたは $(\text{C}_2 - \text{C}_4)$ -アルキニルであり、

$R^6$  は水素、ハロゲン、シアノ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキル、ハロ- $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルコキシ、ハロ- $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルコキシまたは $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^8$ であり、

$R^7$  は $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキルであり、

40

$R^8$  は水素、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキルまたはハロ- $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキルであり、

$R^9$  は水素または $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキルであり、

$n$  は0、1または2である。

## 【0006】

式(I)及び全ての以下の式において、2よりも大きいまたは3よりも大きい炭素原子を有するアルキル、アルケニル及びアルキニル基は、各々、直鎖状または側鎖状でありうる。アルキル基はメチル、エチル、 $n$ -または*i*-プロピル、 $n$ -、*i*-、*t*-または2-ブチルである。

## 【0007】

従って、アルケニルはエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル及び異なるブテニル

50

異性体である。アルキニルはエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル及び異なるブチニル異性体である。アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ及びアルキルチオ等のそれらを組み合わせた意味の定義は同様に理解されるべきである。このように例えばアルキニルオキシは $\text{HC} \quad \text{CCH}_2\text{O}$ 、 $\text{CH}_3\text{C} \quad \text{CCH}_2\text{O}$ 及び $\text{CH}_3\text{C} \quad \text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ である。

【0008】

シクロアルキルはシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルである。

【0009】

ジアルキルアミノ等のような二重に置換されたアミノ基の場合には、これらの2つの置換基は同一でも異なってもよい。

10

【0010】

ハロゲンはフッ素、塩素、臭素、またはヨウ素である。ハロアルキルは部分的にまたは完全にハロゲン、好ましくはフッ素、塩素及び/または臭素により、特にフッ素または塩素、例えば $\text{CF}_3$ 、 $\text{CHF}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{CF}_3\text{CF}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{FCHCl}$ 、 $\text{CCl}_3$ 、 $\text{CHCl}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ で置換されたアルキルであり；ハロアルコキシは例えば $\text{OCF}_3$ 、 $\text{OCHF}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{F}$ 、 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{O}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CF}_3$ 及び $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ であり；このことは同様に他のハロゲン置換基にも適用される。

【0011】

その置換基の性質及び結合の如何にもよるが、式(I)の化合物は立体異性体として存在することができる。もし二重結合が存在するならば、ジアステレオ異性体もありうる。例えば、1またはそれ以上の不整炭素原子があれば、鏡像異性体及びジアステレオマーもありうる。立体異性体は製造時の混合物から標準的な分離法、例えば、クロマトグラフ分離技術により得ることができる。同様に、立体異性体は立体選択的反応並びに光学活性出発物質及び/または助剤を使用して選択的に製造することができる。本発明は更に、それが一般式(I)に含まれる限りにおいて、特に定義されてなくても、全ての立体異性体及びその混合物に関する。

20

【0012】

式(I)の化合物は原則としてN-オキシドを形成することができる。N-オキシドは当業者公知の方法により、過酸、過酸化水素及び過ホウ酸ナトリウム等の酸化剤との反応により製造することができる。そのような方法は例えばT. L. Gilchrist, Comprehensive Organic Synthesis, Volume 7, pages 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Pressに記載されている。

30

【0013】

原則として、式(I)の化合物は以下の化合物に添加することにより塩を形成することができる；

- a) 塩化水素、臭化水素、硝酸、リン酸、硫酸、酢酸、蔞酸等の酸、または
- b) ピリジン、アンモニア、トリエチルアミン、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の塩基。

【0014】

以下に特記しない限り、本発明の化合物の好ましい具体例は各場合におけるN-オキシド及び塩もまた含む。

40

【0015】

有利であることが見出された本発明の化合物は以下の化合物；

$\text{R}^1$ 及び $\text{R}^2$ が互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、ホルミル、ビニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキル、ハロ- $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルキル若しくは $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -アルコキシであり、または

$\text{R}^1$ 及び $\text{R}^2$ が一緒になって $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ であり；

$\text{R}^3$ 及び $\text{R}^4$ が互いに独立して水素、ハロゲン、メチルまたはメトキシであり；

Yは基Y1、Y2、Y3、Y6、Y7、Y8またはY9であり；

そして他の置換基及び記号は各々上述した意味を有する化合物である。

【0016】

50

より一層興味のあるものは一般式 (I) の化合物で、ここで；

R<sup>1</sup> が水素、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、トリフルオロメチル、メトキシ、メチル若しくはエチルであり、

R<sup>2</sup> が水素、ヒドロキシル、メチル、エチル、メトキシ若しくはエトキシであり、または

R<sup>1</sup> と R<sup>2</sup> が一緒になって CH<sub>2</sub> - CH<sub>2</sub> - CH<sub>2</sub> であり；

R<sup>3</sup> と R<sup>4</sup> が互いに独立して、水素またはメチルであり；

そして他の置換基及び記号は各々上述した意味を有する化合物である。

【0017】

一般式 (I) の化合物で好ましいものは、この式において；

R<sup>5</sup> がハロゲン、シアノ、ハロ - (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - アルキル、ハロ - (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - アルコキシまたはハロ - (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - アルキルチオであり、そして他の置換基及び記号は各々上述した意味を有する化合物である。

10

【0018】

特に好ましい一般式 (I) の化合物は、この式において R<sup>2</sup> 及び R<sup>6</sup> が各々水素であり、Y が Y<sub>1</sub>、Y<sub>2</sub>、Y<sub>7</sub>、Y<sub>8</sub> または Y<sub>9</sub> であり、そして他の置換基及び記号は各々上述した意味を有する化合物である。

【0019】

以下の全ての式において、置換基及び記号は特に断らない限り式 (I) に記載されたものと同じ定義を有する。

20

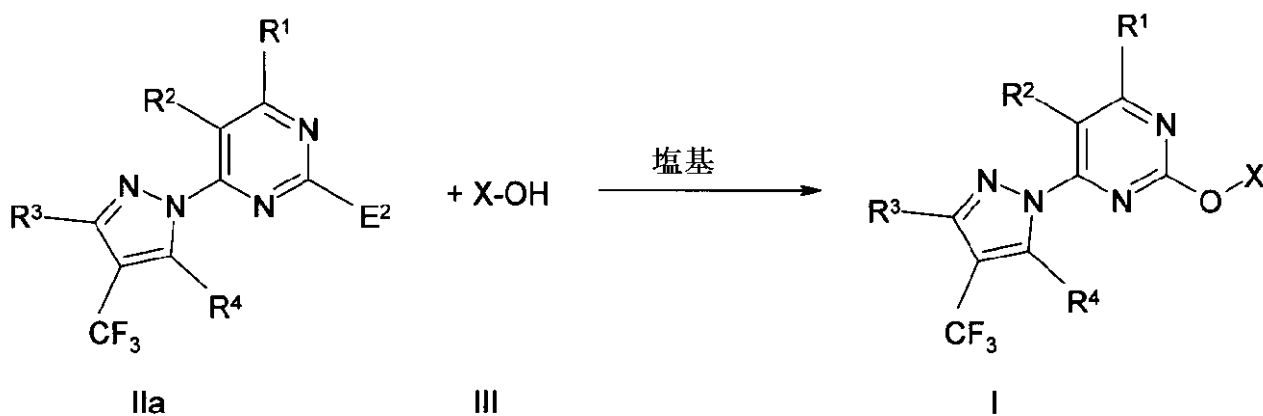
【0020】

本発明の化合物は例えば以下のスキームに示された方法により製造することができる：

スキーム 1 によれば、式 (I) の化合物は式 (III) のヒドロキシ化合物と式 (IIa) のピリミジン類との塩基触媒求核置換反応により製造することができる。式 (IIa) の E<sup>2</sup> はハロゲン、メチルスルホニルまたはトシルのような脱離基である。かかる様な求核置換反応は当業者に公知である。

【化 3】

スキーム 1



30

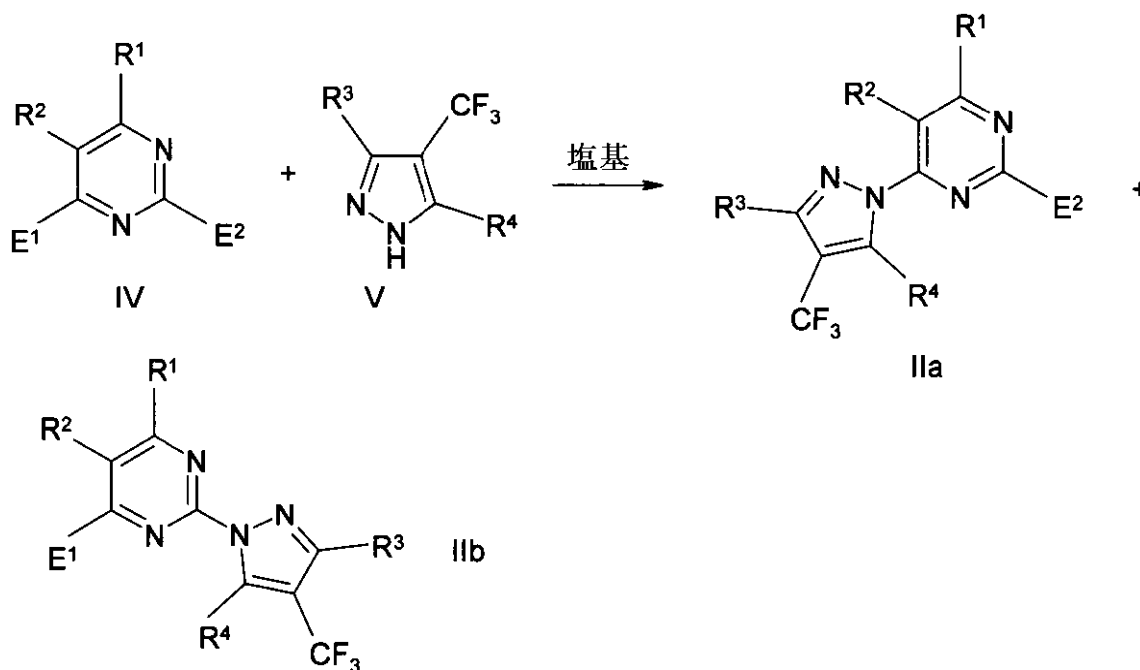
40

【0021】

E<sup>2</sup> がハロゲンである式 (IIa) の化合物は例えばスキーム 2 に従って、E<sup>1</sup> 及び E<sup>2</sup> がハロゲンである式 (IV) のピリミジン類と式 (V) のピラゾール類との塩基触媒置換反応によって製造することができる。ここで、それぞれの位置異性体 (IIb) もまた製造可能である；位置異性体類は例えばクロマトグラフ精製により分離することができる。当業者はその様な反応には習熟している。

【化4】

スキーム2

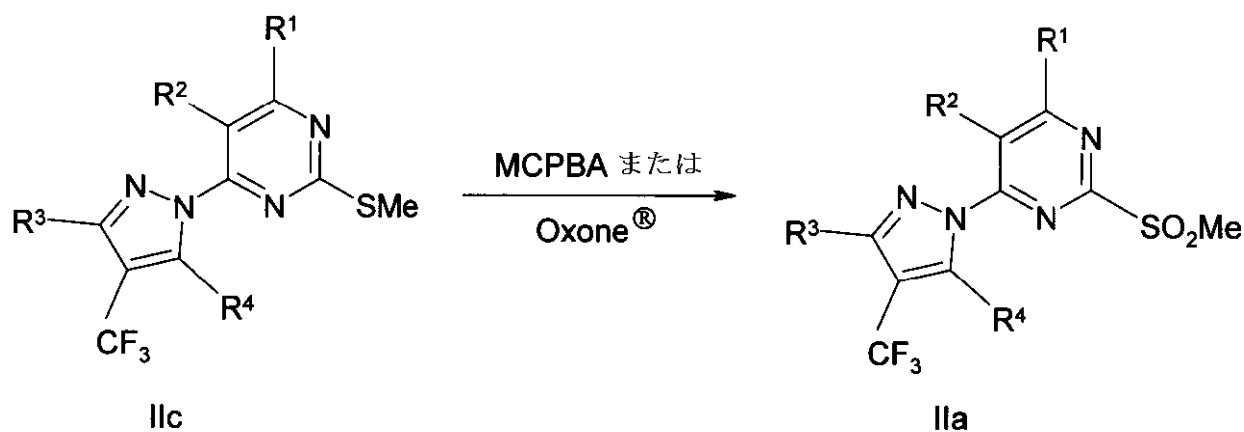


【0022】

$E^2$ がメチルスルホニルである式(IIa)の化合物は例えば式スキーム3に従って、式(IIc)の化合物からm-クロロ過安息香酸(MCPBA)またはOxone(登録商標)による酸化によって製造することができる。かかる反応は当業者にとっては、例えば、J. March, Advanced Organic Chemistry, John Wiley, New York, 2001, 第5版 1541~1542頁から公知である。

【化5】

スキーム3



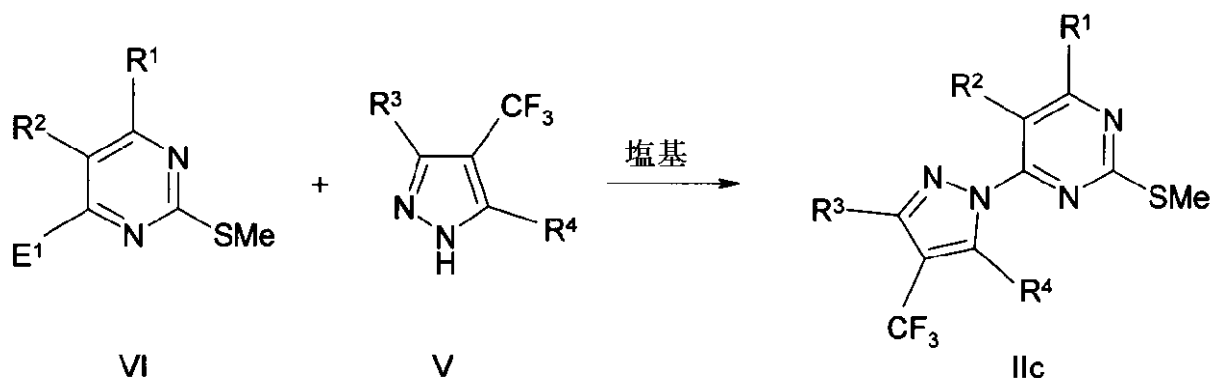
【0023】

式(IIc)の化合物は、例えばスキーム4に従って、 $E^1$ がハロゲンのような脱離基である式(VI)のピリミジン類と式(V)のピラゾール類との塩基触媒反応によって製造することができる。



【化6】

## スキーム4



10

【0024】

E1がハロゲンのような脱離基である式(VI)の化合物は、例えば2-チオメチル-4-ヒドロキシピリミジン類と $\text{POCl}_3$ との反応により製造することができる。かかる方法は当業者に公知であり、例えばHouben-Weyl, *Methods of Organic Chemistry*, Vol. E9b, Part 1, 1998, 209~210頁に記載されている。置換2-チオメチル-4-ヒドロキシピリミジン類は例えばHouben-Weyl, *Methods of Organic Chemistry*, Vol. E9b, Part 1, 1998, 46、47、49及び50頁に記載されている当業者に公知の方法により製造することができる。式(V)のピラゾール類は同様に当業者公知の方法により製造することができる。4-トリフルオロメチルピラゾールの製造は例えばTetrahedron Letters, 37, 1996, 1829~1830頁に記載されている。

20

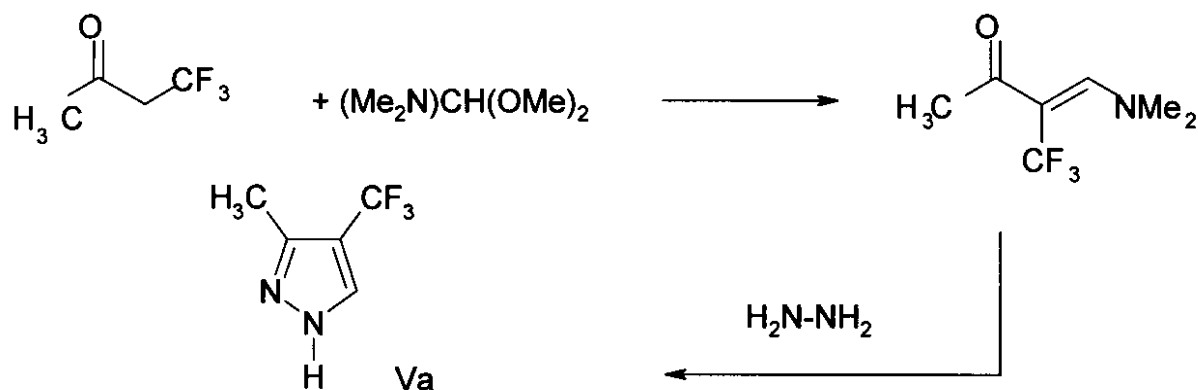
【0025】

3-メチル-トリフルオロメチルピラゾール(Va)はスキーム5に従って製造することができる。

30

【化7】

## スキーム5



40

【0026】

本発明の式(I)の化合物は広い範囲の経済的に重要な単子葉植物雑草類及び双子葉植物雑草類に対する優秀な除草活性を有する。活性物質は、多年生雑草を防除し、同様にまた、容易に防除することができない、苗条を作り出す地下茎、根茎または他の多年生器官

50

をよく防除する。これに関連して、この活性物質を種まき前、発芽前または発芽後適用するかどうかは問題ではない。本発明の化合物によって防除することができる単子葉植物雑草フロラ及び双子葉植物雑草フロラの若干の代表例が実施例として個々に記載されているが、しかし、これを特定の種として限定を意味するものであると取るべきではない。よく防除することができる単子葉植物雑草種としては、例えば1年生のグループとしてはアベナ (*Avena*)、ロリウム (*Lolium*)、アロペクルス (*Alopecurus*)、ファラリス (*Phalaris*)、エキノクロア (*Echinochloa*)、ディジタリア (*Digitaria*)、セタリア (*Setaria*) 及びシペルス (*Cyperus*) 種並びに多年生種としてはアグロピロン (*Agropyron*)、シノドン (*Cynodon*)、インペラタ (*Imperata*) 及びソルグム (*Sorghum*) または他の多年生シペルス (*Cyperus*) 種である。双子葉植物雑草種の場合、作用のスペクトルは例えば1年生 10  
グループとしてはガリウム (*Galium*)、ピオラ (*Viola*)、ペロニカ (*Veronica*)、ラミウム (*Lamium*)、ステラリア (*Stellaria*)、アマランス (*Amaranthus*)、シナピス (*Sinapis*)、イポメア (*Ipomoea*)、シダ (*Sida*)、マトリカリア (*Matricaria*) 及びアブチロン (*Abutilon*) 並びに多年生としてはコンボルブルス (*Convolvulus*)、シルシウム (*Cirsium*)、ルメックス (*Rumex*) 及びアルテミシア (*Artemisia*) にまで及ぶ。例えばエチノクロア (*Echinochloa*)、サギッタリア (*Sagittaria*)、アリスマ (*Alisma*)、エレオカリス (*Eleocharis*)、スキルプス (*Scirpus*) 及びシペルス (*Cyperus*) 等のコメの特定の育成条件化で発見される有害植物もまた本発明の活性物質により顕著に防除される。もし本発明の化合物が発芽前に土壤表面に適用された場合、雑草の実生の発芽が完全に妨げられるか、またはその雑草は子葉段階に達するまで生長するが、生長は停止し、そして3 20  
~ 4 週間の期間の後、その植物は最終的には完全に死滅する。活性物質が植物の発芽後、緑色部分に適用された場合、生長もまた処置の直後に劇的に停止し、雑草は適用時の生長段階に留まり、またはある一定の時間の後、完全に死滅し、その結果、作物にとっては有害な雑草との競争は非常に早い段階で、持続する方法で解消される。特に、本発明の化合物はアマランスレトロフレクサス (*Amaranthus retroflexus*)、アベナエスピー (*Avena* sp.)、エチノクロアエスピー (*Echinochloa* sp.)、シペルスセロチナス (*Cyperus serotinus*)、ロリウムマルチフロルム (*Lolium multiflorum*)、セタリアビリヂス (*Setaria viridis*)、サギッタリアピグメア (*Sagittaria pygmaea*)、スキルプスジュンコイデス (*Scirpus juncooides*)、シナピスエスピー (*Sinapis* sp.) 及びステラリアメディア (*Stellaria media*) に対する顕著な作用を有する。 30

#### 【0027】

本発明の化合物は単子葉植物雑草及び双子葉植物雑草に対する顕著な除草活性を有するが、例えばコムギ、オオムギ、ライムギ、コメ、トウモロコシ、テンサイ、ワタの木及びダイズ等の経済的に重要な作物に対してはもし有るとしても単に無視すべき損傷に過ぎない。特に、コムギ、オオムギ、トウモロコシ、コメ及びダイズは本発明の化合物に対して著しくよく耐える。これが本発明の化合物が農業用植物または観賞用植物の見地において望ましくない植物を選択的に制御するのに非常に好適である理由である。

#### 【0028】

それらの除草特性のために、活性物質は公知の植物または未だ開発途上の遺伝子修飾された植物の集団中における有害植物を制御するためにも適用することができる。原則として、遺伝子移植植物は特に有用な特性、例えば特定の農薬、特に特定の除草剤に対する抵抗性、植物の病気または植物の病気の原因となる生物、例えば特定の昆虫、または菌類、バクテリア若しくはウイルス等の微生物に対する抵抗性により特徴付けられる。他の特有の性質は例えば、作物の量、質、貯蔵安定性、組成及び特定の構成物質に関係する。従って、遺伝子移植植物は澱粉含有量の増加したもの、澱粉の質が改良されているもの、または収穫された物質の脂肪酸のスペクトルが異なるものとして知られている。 40

#### 【0029】

本発明の式 (I) の化合物またはそれらの塩は有用な植物及び観賞用植物、例えばコムギ、オオムギ、ライムギ、カラスムギ、キビ、コメ、カサバ及びトウモロコシのような穀物、またはテンサイ、ワタの木、ダイズ、菜種 (*oil seed rape*)、ポテト、 50

トマト、エンドウマメ等のその他の作物、並びに他の野菜、の経済的に重要な遺伝子移植作物に好適に使用される。式( I )の化合物は、除草剤の植物に有害な影響に対して抵抗性がある、または抵抗性があるように遺伝子的に修飾された有用な植物の集団中における除草剤として好適に使用することができる。

#### 【0030】

既存の植物と比較して修飾された性質を有する新規な植物が発生するための従来からの経路は例えば伝統的な品種改良法と突然変異体の発生である。一方、修飾された性質を有する新規な植物は組み換え法の助けを借りて発生させることができる(例えばEP-A-0221044、EP-A-0131624を参照)。例えば以下に若干のケースを記載する；

10

- 植物中に合成される澱粉を改質するための作物の組み換え修飾(例えばWO92/11376、WO-92/14827、WO-91/19806)、
- グルホシネート(*glufosinate*)型(例えばEP-A-0242236、EP-A-242246参照)、グリホセート(*glyphosate*)型(WO92/00377)またはスルホニル尿素型(EP-A-0257993、US-A-5013659)の特定の除草剤に対して抵抗性を示す遺伝子組換え作物植物、
- 遺伝子組換え作物植物、例えば植物に特定の害虫に対する抵抗性を付与するバチルスリンジエンシス毒素(Bt毒素)を産生する能力を有するワタの木(EP-A-0142924、EP-A-0193259)、
- 改質された脂肪酸スペクトルを有する遺伝子組換え作物植物(WO-91/13972)。

20

#### 【0031】

改質された性質を有する新規な遺伝子組換え植物の助けを得て、分子生物学における多数の技術が生みだされており、それらは原則的には公知である；例えば以下を参照。

Sambrook et al., 1989, *Molecular Cloning, A Laboratory Manual*, 2nd Ed., Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; または Winnacker "Gene und Klone" [*Genes and Clones*], VCH Weinheim 2nd Edition 1996; または Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431。

30

#### 【0032】

そのような組み換え操作を実行するために、核酸分子をDNA配列の再組み換えによって突然変異誘発または配列変更を可能にするプラスミドに導入することができる。上述した標準的な方法を用いて、例えば塩基置換を行うこと、部分配列を除去すること、または天然の若しくは合成の配列を添加することが可能である。フラグメントは、DNAフラグメントを互いに連結するために、アダプターまたはリンカーにより提供される。

#### 【0033】

遺伝子生産物の活性の低下した植物細胞は、例えば、少なくともひとつの相当するアンチセンスRNA若しくは共抑制効果(*cosuppression effect*)を達成するためのセンスRNAを発現することにより、または上述した遺伝子生産物の転写を特定の切断する少なくともひとつの好適に構築されたりボザイムの発現により得ることができる。

40

#### 【0034】

このために、一方では、存在するかもしれないフランキング配列をも含めて遺伝子生産物の全てのコード配列を包含するDNA分子を用いることのみならず、単に一部のコード配列を包含するDNA分子であって、これらの部分が細胞のアンチセンス効果を引き起こす限りにおいて存在することが必要であるものも用いることができる。もうひとつの可能性は、遺伝子生産物のコード配列に関して高度に相同性を有しているが、完全には一致しないDNA配列の使用である。

50

## 【0035】

植物において核酸分子を発現するとき、合成された蛋白質は、植物細胞のどの所望のコンパートメントに局在化させることができる。しかしながら、特定のコンパートメントに局在化させるためには、例えばコーディング領域を特定のコンパートメントに局在化を確実にするDNA配列に連結することができる。このような配列は当業者には公知である（例えば、Braun et al., EMBO J 11 (1992), 3219-3227; Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnwald et al., Plant J. 1 (1991), 95-106）。

## 【0036】

遺伝子組換え植物細胞は公知の技術により再生することができ、無傷の植物が得られる。原則として、遺伝子組換え植物は如何なる所望の植物種の植物、すなわち、単子葉植物及び双子葉植物の両方、であることができる。

## 【0037】

かくして相同（すなわち、天然）遺伝子若しくは遺伝子配列の過剰発現、抑圧若しくは抑制または非相同（すなわち、異質）遺伝子若しくは遺伝子配列の発現に起因する改変された性質を示す遺伝子組換え植物が得られる。

## 【0038】

本発明の活性物質を遺伝子組換え作物に使用した場合、その効果は他の作物で観察される有害植物に対する効果（その作用は問題の遺伝子組換え作物の適用に固有である）に加えて、例えば制御することができる修飾されまたは固有の雑草スペクトルの拡大、施用のために用いることができる改変された施用割合、好ましくは遺伝子組換え作物が抵抗性を有する除草剤との良好な組み合わせ性並びに遺伝子組換え作物の生長及び収量に対する効果がしばしば観察される。それ故に本発明はまた遺伝子組換え作物における有害植物を制御するための除草剤としての、本発明の化合物の使用に関する。

## 【0039】

本発明の物質は更に作物の顕著な生長調節性を有する。本発明の物質は調節されたやり方で植物の代謝に関与し、このようにして植物構成体の目標とされた防除のために、収穫を容易にするために、例えば乾燥及び生長阻害の引き金になること等のために施用することができる。更に、それらはその過程で植物を破壊することなく、望まない植物の生長を制御し、そして抑制するのにもまた好適である。植物の生長を抑制することは単子葉作物及び双子葉作物において重要な役割を果たすもので、倒伏を減少させるか完全に防止する。

## 【0040】

本発明の化合物は通常製の剤において、水和剤、乳剤、噴霧溶液、粉剤または粒剤の形態で適用することができる。それ故に、本発明は更に式(I)の化合物を含む除草剤組成物に関する。式(I)の化合物は広く行われている生物学的及び/または物理化学的パラメーターに従って、多くの方法で処方することができる。可能であり、好適な製剤の例は水和剤(WP)、水溶性粉末(SP)、水溶性製剤、乳剤(EC)、乳液(EW)(水中油乳液または油中水乳液のような)、噴霧溶液、懸濁剤(SC)、油または水ベース分散液、油混和性溶液、カプセル懸濁液(CS)、粉剤(DP)、種子粉衣生成物、散布及び土壌施用のための粒剤、微小粒子の形態の粒剤(GR)、噴霧粒剤、被覆粒剤及び吸着粒剤、水分散性粒剤(WG)、水溶性粒剤(SG)、ULV製剤、ミクロカプセル並びにワックスである。これらの個々の製剤型は原則として公知であり、例えば、Winnacker-Kuechler, "Chemische Technologie" [Chemical Technology], Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4th Ed. 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N. Y. 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. Londonに記載されてい

10

20

30

40

50

る。

【0041】

不活性物質、界面活性剤、溶媒及びその他の添加剤等の必要とされる製剤助剤は同様に公知であり、例えばWatkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Dartland Books, Caldwell N.J., H.V. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide"; 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schonfeldt, "Grenzflaechenaktive Aethylenoxidaddukte" [Surface-active ethylene oxide adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Kuechler, "Chemische Technologie", Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4th Ed. 1986に記載されている。

10

【0042】

水和剤は水中に均一に分散し得る製剤であり、それは活性物質に加えて、例えばポリオキシエチル化アルキルフェノール、ポリオキシエチル化脂肪アルコール、ポリオキシエチル化脂肪アミン、脂肪アルコールポリグリコールエーテルサルフェート、アルカンシルホネート、アルキルベンゼンスルホネート、ナトリウム2, 2'-ジナフチルメタン-6, 6'-ジスルホネート、ナトリウムリグノスルホネート、ナトリウムジブチルナフタレンスルホネートまたはその他ナトリウムオレオイルメチルタウレート等のイオン性及び/または非イオン性界面活性剤(湿潤剤、分散剤)もまた含み、更に希釈剤または不活性物質を含む。水和剤を製造するために、除草活性物質を例えば一般的な装置中で、例えばハンマーミル、ブローイングミル、エアージェットミル中で細かくなるまで粉碎し、そして同時にまたは引き続き製剤助剤と混合する。

20

30

【0043】

乳剤は活性物質を1またはそれ以上のイオン性及び/または非イオン性の界面活性剤(乳化剤)の添加と共に、ブタノール、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、キシレン若しくは他の高沸点芳香族化合物または炭化水素等の有機溶媒、または有機溶媒の混合物中に溶解することによって製造される。使用することができる乳化剤の例としてはカルシウムドデシルベンゼンスルホネートのようなカルシウムアルキルアリアルスルホネート塩、または脂肪酸ポリグリコールエステル、アルキルアリアルポリグリコールエーテル、脂肪アルコールポリグリコールエーテル、プロピレンオキシド/エチレンオキシド縮合物、アルキルポリエーテル、例えばソルピタン脂肪酸エステル若しくはポリオキシエチレンソルピタンエステル(例えばポリオキシエチレンソルピタン脂肪酸エステル)のようなソルピタンエステル等の非イオン性乳化剤である。

40

【0044】

粉剤は活性物質を細かく分割された固体物質、例えばタルク、例えばカオリン、ベントナイト及び葉蠟石等の天然クレーまたは珪藻土と共に粉碎することによって得られる。

【0045】

懸濁剤は水をベースにしたものかまたは油をベースにしたものであることができる。それらは慣用のビードミルによって湿式粉碎し、もし適当なら他の製剤型の場合の上記例で既に述べたような界面活性剤を添加して製造することができる。

【0046】

乳液、例えば水中油乳液(EW)は水性有機溶媒を使用して、攪拌機、コロイドミル、

50

及び/またはスタティックミキサーによって、そしてもし適当なら他の製剤型の場合の上記例で既に述べたような界面活性剤を添加して製造することができる。

【0047】

粒剤は活性物質を吸収性の粒状化された不活性物質上に噴霧するか、または活性物質濃縮物を担体、例えば砂、カオリナイト若しくは粒状化された不活性物質の表面へ粘着剤、例えばポリビニルアルコール、ナトリウムポリアクリレート若しくは他の鉱油を用いて、塗布することにより製造することができる。

好適な活性物質は、肥料粒子の生産の一般的なやり方で、もし所望なら肥料との混合物として、粒状化することができる。

【0048】

水分散性粒剤は通常スプレー乾燥、流動床粒状化、ディスク粒状化、高速攪拌機で混合すること及び固体不活性物質の不存在下の押し出しのような一般的な方法によって製造する。

【0049】

ディスク粒子、流動床粒子、押し出し粒子及びスプレー粒子を製造することについては、例えば“Spray-Drying Handbook” 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J. E. Browning, “Agglomeration”, Chemical and Engineering 1967, pages 147 以下; “Perry’s Chemical Engineer’s Handbook”, 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, pp. 8-57を参照されたい。

【0050】

作物保護生産物の製剤についての更なる詳細は、例えばG. C. Klingman, “Weed Control as a Science”, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pages 81-96 and J. D. Freyer, S. A. Evans, “Weed Control Handbook”, 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, pages 101-103を参照されたい。

【0051】

原則として、この農芸化学的製剤は式(I)の活性物質0.1~99質量%、特に0.1~95質量%を含む。水和剤においては、活性物質濃度は例えば約10~90質量%からなり、残りの100質量%までは一般的な製剤構成物質からなる。乳剤の場合においては、活性物質は合計約1~90、好ましくは5~80質量%になる。粉剤の形態の製剤の場合、活性物質を1~30質量%、好ましくは大抵の場合5~20質量%を含み、噴霧溶液の場合、約0.05~80、好ましくは2~50質量%の活性物質を含む。水分散性粒剤の場合、活性物質含量は部分的には使用される活性化化合物が液体形態か、または固体形態であるか、及び造粒助剤、充填剤等に依存する。水分散性粒剤の場合、例えば活性物質含量は1~95質量%、好ましくは10~80質量%である。

【0052】

更に、既述の活性物質製剤は、適当なら、粘着付与剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、浸透剤、防腐剤、凍結防止剤、溶媒、充填剤、担体、着色料、消泡剤、蒸発防止剤並びにPH及び粘度調節剤を含むが、それら各々の場合、従来からのものである。

【0053】

これらの製剤に基づいて、例えば殺虫剤、ダニ駆除剤、除草剤、殺菌剤等の他の農薬活性物質と共に、及び毒性緩和剤、肥料及び/または生長調節剤と共に、例えば予め混合された(レディーミックス)またはタンクミックスの形態で、組み合わせることもできる。

【0054】

本発明の活性物質と組み合わせる、混合製剤で、またはタンクミックスで用いることが

10

20

30

40

50

できる活性物質は、例えばWeed Research 26, 441 - 445 (1986) または“ The Pesticide Manual ”, 11th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 1997及びそれらに引用された文献に記載されているように公知の活性物質である。ここで述べなければならない、そして式(I)の化合物と組み合わせることができる公知の除草剤は例えば以下の活性物質である(注: 化合物は国際標準化機構(I S O)による一般名によって示されるか、または化学名、適当なら、通常のコード番号と共に示されている): アセトクロール; アシフルオルフェン; アクロニフェン; A K H - 7 0 8 8、すなわち[[[1 - [5 - [2 - クロロ - 4 - (トリフルオロメチル) - フェノキシ] - 2 - ニトロフェニル] - 2 - メトキシエチリデン]アミノ]オキシ]酢酸及びそのメチルエステル; アラクロール; アロキシジム; アメトリン; アミドスルフロニ; アミトロール; A M S 即ちアンモニウムスルファメート; アニロフォス; アスラム; アトラジン; アジムスルフロニ(D P X - A 8 9 4 7); アジプロトリン; パーバン; B A S 5 1 6 H、即ち5 - フルオロ - 2 - フェニル - 4 H - 3, 1 - ベンゾオキサジン - 4 - オン; ベナゾリン; ベンフルラリン; ベンフレセート; ベンスルフロニメチル; ベンスリド; ベンタゾン; ベンゾフェナップ; ベンゾフルオール; ベンゾイルプロップ - エチル; ベンゾチアズロン; ビアラホス; ビフェノックス; プロマシル; プロモブチド; プロモフェノキシム; プロモオキシニル; プロムロン; プミナホス; プソキシノン; プタクロール; プタミホス; プテナクロール; プチダゾール; プトラリン; プチレート; カフェンストロール(C H - 9 0 0); カルベタミド; カフェントラゾン(I C I - A 0 0 5 1); C D A A 即ち2 - クロロ - N, N - ジ - 2 - プロペニルアセトアミド; C D E C 即ち2 - クロロアリル - ジエチルジチオカルバメート; クロメトキシフェン; クロランベン; クロラジホップ - ブチル, クロルメスロン(I C I - A 0 0 5 1); クロルプロムロン; クロルブハム; クロルフェナック; クロルフルレコール - メチル; クロリダゾン; クロリムロンエチル; クロルニトロフェン; クロロトルロン; クロロックスウロン; クロルプロハム; クロルスルフロニ; クロルタール - ジメチル; クロルサイアミド; シンメチリン; シノスルフロニ; クレトジム; クロジナホップ及びそのエステル誘導体(例えばクロジナホップ - プロパルギル); クロメプロップ; クロプロキシジム; クロピラリド; クミルウロン(J C 9 4 0) シアナジン; シクロエート; シクロスルファミロン(A C 1 0 4); シクロオキシジム; シクルロン; シハロホップ及びそのエステル誘導体(例えばブチルエステル、D E H - 1 1 2); サイパークアート; シブラジン; シブラゾール; ダイムロン; 2, 4 - D B; ダラポン; デスメディハム; デスメトリン; ジ - アレート; ジカンバ; ジクロベニル; ジクロルプロップ; ジクロホップ及びそのエステル、例えばジクロホップ - メチル; ジエタチル; ジフェノックスウロン; ジフェンゾクアート; ジフルフェニカン; ジメフロニ; ジメタクロール; ジメタメトリン; ジメテナミド(S A N - 5 8 2 H); ジメタゾン; クロマゾン; ジメチピン; ジメトラスルフロニ; ジニトラミン; ジノセブ; ジノターブ; ジフェナミド; ジプロペトリン; ジクアート; ジチオピル; ジウロン; D N O C; エグリナジン - エチル; E L 7 7、即ち5 - シアノ - 1 - (1, 1 - ジメチルエチル) - N - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カロボキシアミド; エンドタール; E P T C; エスプロカルブ; エタルフルラリン; エタメトスルフロニ - メチル; エチジムロン; エチオジン; エトフメセート; F 5 2 3 1、即ちN - [2 - クロロ - 4 - フルオロ - 5 - [4 - (3 - フルオロプロピル) - 4, 5 - ジヒドロ - 5 - オキソ - 1 H - テトラゾール - 1 - イル]フェニル]エタンスルホンアミド; エトキシフェン及びそのエステル(例えばエチルエステル、H N - 2 5 2) エトベンザニド(H W 5 2); フェノプロップ; フェノキサン; フェノキサプロップ及びフェノキサプロップ - P並びにそれらのエステル、例えばフェノキサプロップ - P - エチル及びフェノキサプロップ - エチル; フェノキシジム; フェヌロン; フランプロップ - メチル; フラザスルフロニ; フルアジホップ及びフルアジホップ - P並びにそれらのエステル、例えばフルアジホップ - ブチル及びフルアジホップ - P - ブチル; フルクトラリン; フルメツラム; フルメツロン; フルミクロラック及びそのエステル(例えばベンチルエステル、S - 2 3 0 3

1 ) ; フルミオキサジン ( S - 4 8 2 ) ; フルミプロピン ; フルボキサム ( K N W - 7 3  
 9 ) ; フロオロジフェン ; フロオログリコフェン - エチル ; フルプロパシル ( U B I C -  
 4 2 4 3 ) ; フルリドン ; フロクロリドン ; フロロキシピル ; フルルタモン ; ホメサフ  
 エン ; ホサミン ; フロロキシフェン ; グルホシネート ; グリホサート ; ハロサフェン ; ハ  
 ロスルフロロン及びそのエステル ( 例 えばメチルエステル、 N C - 3 1 9 ) ; ハロキシホッ  
 プ及びそのエステル ; ハロキシホップ - P ( = R - ハロキシホップ ) 及びそのエステル ;  
 ヘキサジノン ; イマザビル ; イマザメタベンズ - メチル ; イマザクイン及びその塩、 例 え  
 ばアンモニウム塩 ; イオキシニル ; イマゼタメタピル ; イマゼタピル ; イマゾスルフロ  
 ン ; イソカルバミド ; イソプロパリン ; イソプロトウロン ; イソウロン ; イソキサベン ; イ  
 ソキサピリホップ ; カルブチレート ; ラクトフェン ; レナシル ; リヌロン ; M C P A ; M  
 C P B ; メコプロップ ; メフェナセト ; メフルイジド ; メタミトロン ; メタザクロール ;  
 メタム ; メタベンゾチアズロン ; メタゾール ; メトキシフェノン ; メチルジムロン ; メタ  
 ベンゾウロン ; メトベンゾウロン ; メトブロムロン ; メトラクロール ; メトスラム ( X R  
 D 5 1 1 ) ; メトクスウロン ; メトリブジン ; メトスルフロロン - メチル ; M H ; モリネー  
 ト ; モナリド ; モノリンウロン ; モヌロン ; モノカルバミドジハイドロジェンサルフェー  
 ト ; M T - 1 2 8 、 即 ち 6 - クロロ - N - ( 3 - クロロ - 2 - プロペニル ) - 5 - メチル  
 - N - フェニル - 3 - ピリダジンアミン ; M T - 5 9 5 0 、 即 ち N - [ 3 - クロロ - 4 -  
 ( 1 - メチルエチル ) フェニル ] - 2 - メチルペンタンアミド ; ナプロアニリド ; ナプロ  
 パミド ; ナブタラム ; N C 3 1 0 、 即 ち 4 - ( 2 , 4 - ジクロロベンゾイル ) - 1 - メチ  
 ル - 5 - ベンジルオキシピラゾール ; ネブウロン ; ニコスルフロロン ; ニピラクロフェン ;  
 ニトラリン ; ニトロフェン ; ニトロフルオルフェン ; ノルフルラゾン ; オルベンカルブ ;  
 オリザリン ; オキサジアルジル ( R P - 0 2 0 6 3 0 ) ; オキサジアゾン ; オキシフルオ  
 ルフェン ; パラクアート ; ペプレート ; ベンジメタリン ; パーフルイドン ; フェニソファ  
 ム ; フェンメジファミン ; ピクロラム ; ピノキサデン ; ピペロホス ; ピリブチカルブ ; ピリ  
 フェノップ - ブチル ; プレチラクロール ; プリミスルフロロン - メチル ; プロシアジン ; プ  
 ロジアミン ; プロフルラリン ; プログリナジン - エチル ; プロメトン ; プロメトリン ; プ  
 ロパクロール ; プロパニル ; プロパキサホップ及びそのエステル ; プロパジン ; プロハム  
 ; プロピソクロール ; プロピザミド ; プロスルファリン ; プロスルホカルブ ; プロスルフ  
 ロン ( C G A - 1 5 2 0 0 5 ) ; プリナクロール ; ピラクロニル ; ピラゾリネート ; ピラ  
 ゾン ; ピラゾスルフロロン - エチル ; ピラゾキシフェン ; ピリデート ; ピリチオバック ( K  
 I H - 2 0 3 1 ) ; ピロキソホップ及びそのエステル ( 例 えばプロパルギルエステル ) ;  
 クインクロラック ; クインメラック ; クイノホップ及びそのエステル誘導体、 キザロホッ  
 プ及びキザロホップ - P 並びにそれらのエステル誘導体、 例 えばキザロホップ - エチル ;  
 キザロホップ - P - テフリル及び - エチル ; レンリッドウロン ; リムスルフロロン ( D P X  
 - E 9 6 3 6 ) ; S 2 7 5 、 即 ち 2 - [ 4 - クロロ - 2 - フルオロ - 5 - ( 2 - プロピニ  
 ルオキシ ) フェニル ] - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 2 H - インダゾール ; セクブメ  
 トン ; セトキシジム ; シズロン ; シマジン ; シメトリン ; S N - 1 0 6 2 7 9 、 即 ち 2 -  
 [ [ 7 - [ 2 - クロロ - 4 - ( トリフルオロメチル ) フェノキシ ] - 2 - ナフタレニル ] オキ  
 シ ] プロパン酸及びそのメチルエステル ; スルフェントラゾン ( F M C - 9 7 2 8 5 、 F  
 - 6 2 8 5 ) ; スルファズロン ; スルホメツロン - メチル ; スルホセート ( I C I - A 0  
 2 2 4 ) ; T C A ; テブタム ( G C P - 5 5 4 4 ) ; テブチウロン ; テルバシル ; テルブ  
 カルブ ; テルブクロル ; テルブメトン ; テルブチルアジン ; テルブトリン ; T F H - 4 5  
 0 、 即 ち N , N - ジエチル - 3 - [ ( 2 - エチル - 6 - メチルフェニル ) スルホニル ] - 1  
 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - カルボキサミド ; テニルクロール ( N S K - 8 5  
 0 ) ; チアザフルロン ; チアゾピル ( M o n - 1 3 2 0 0 ) ; チジアジミン ( S N - 2 4  
 0 8 5 ) ; チオベンカルブ ; チフェンスルフロロン - メチル ; チオカルバジル ; トラルコキ  
 シジム ; トリ - アレート ; トリアスルフロロン ; トリアゾフェンアミド ; トリベヌロン - メ  
 チル ; トリクロピル ; トリジファン ; トリエタジン ; トリフルラリン ; トリフルスルフロ  
 ン及びエステル ( 例 えばメチルエステル、 D P X - 6 6 0 3 7 ) ; トリメツロン ; トシトデ  
 フ ; ベルノレート ; W L 1 1 0 5 4 7 、 即 ち 5 - フェノキシ - 1 - [ 3 - ( トリフルオロ

10

20

30

40

50



メチル)フェニル]-1H-テトラゾール; UBH-509; D-489; LS-82-556; KPP-300; NC-324; NC-330; KH-218; DPX-N8189; SC-0774; DOWCO-535; DK-8910; V-53482; PP-600; MBH-001; KIH-9201; ET-751; KIH-6217並びにKIH-2023。

【0055】

商業的に利用可能な形態で存在する製剤は使用のためには、水和剤、乳剤、分散液及び水溶性粒剤の場合、例えば水を使用して、通常の方法で希釈する。粉剤、土壌粒剤、散布及び噴霧溶液のための粒剤の形態での製剤は、通常使用前に更に他の不活性物質で希釈することはない。

10

【0056】

式(I)の化合物の要求される施用割合は外部条件、例えば、特に温度、湿度及び使用する除草剤の性質、により変化する。それは広い範囲に変化させることができ、例えば活性物質0.001~1.0kg/haまたはそれ以上であるが、しかし好ましくは0.005~750g/haである。

【0057】

以下の実施例は発明を例示する。

A. 化学実施例

6-エチル-4-(4-トリフルオロメチル-1H-1-ピラゾリル)-2-(2-トリフルオロメチルピリジン-4-イルオキシ)ピリミジン(No.1.25)の製造:

20

アセトニトリル20ml中の6-エチル-4-(4-トリフルオロメチル-1H-1-ピラゾリル)-2-メチルスルホニルピリミジン0.4g(1.25ミリモル)、4-ヒドロキシ-2-トリフルオロメチルピリジン0.2g(1.25ミリモル)及び $K_2CO_3$ 0.345g(2.5ミリモル)の混合物を還流下に8時間攪拌し、その後室温で一夜放置した。混合物を水40ml中に投入し、各場合 $CH_2Cl_2$ 20mlで4度抽出した。合わせた有機層を $Na_2SO_4$ で乾燥し、濃縮した。ヘプタン/酢酸エチル(1:1)を使用したシリカゲル上のクロマトグラフ精製により6-エチル-4-(4-トリフルオロメチル-1H-1-ピラゾリル)-2-(2-トリフルオロメチルピリジン-4-イルオキシ)ピリミジン0.33g(65%)を得た。

$^1H$ -NMR: [ $CDCl_3$ ] 1.35 (t, 3H), 2.85 (q, 2H), 7.45 (dd, 1H), 7.70 (s, 2H), 7.95 (s, 1H), 8.00 (d, 1H), 8.70 (s, 1H)。

30

【0058】

6-メチル-4-(4-トリフルオロメチル-1H-1-ピラゾリル)-2-(2-トリフルオロメチルピリジン-4-イルオキシ)ピリミジン(No.1.13)の製造:

アセトニトリル20ml中の6-メチル-4-(4-トリフルオロメチル-1H-1-ピラゾリル)-2-クロロピリミジン0.63g(2.4ミリモル)、4-ヒドロキシ-2-トリフルオロメチルピリジン0.39g(2.4ミリモル)及び $K_2CO_3$ 0.66g(4.8ミリモル)の混合物を還流下に8時間攪拌し、その後室温で一夜放置した。混合物を水40ml中に投入し、各場合 $CH_2Cl_2$ 20mlで4度抽出した。合わせた有機層を $Na_2SO_4$ で乾燥し、濃縮した。ヘプタン/酢酸エチル(7:3)を使用したシリカゲル上のクロマトグラフ精製により6-メチル-4-(4-トリフルオロメチル-1H-1-ピラゾリル)-2-(2-トリフルオロメチルピリジン-4-イルオキシ)ピリミジン0.8g(85%)を得た。

40

$^1H$ -NMR: [ $CDCl_3$ ] 2.60 (s, 3H), 7.43 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.70 (s, 1H), 8.80 (d, 1H)。

【0059】

6-メトキシ-4-(4-トリフルオロメチル-1H-1-ピラゾリル)-2-(1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-イルオキシ)ピリミジン(No.9.37)の製造:

アセトニトリル5ml中の6-メトキシ-4-(4-トリフルオロメチル-1H-1-

50

ピラゾリル) - 2 - メチルスルホニルピリミジン 0.35 g (1.09ミリモル)、1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 2 - ピラゾリン - 5 - オン 0.18 g (1.09ミリモル) 及び  $K_2CO_3$  0.3 g (2.17ミリモル) の混合物を還流下に 8 時間攪拌し、その後室温で一晩放置した。混合物を水 40 ml 中に投入し、各場合  $CH_2Cl_2$  20 ml で 4 度抽出した。合わせた有機層を  $Na_2SO_4$  で乾燥し、濃縮した。ヘプタン/酢酸エチル (1 : 1) を使用したシリカゲル上のクロマトグラフ精製により 6 - メトキシ - 4 - (4 - トリフルオロメチル - 1H - 1 - ピラゾリル) - 2 - (1 - メチル - 3 - トリフルオロメチルピラゾール - 5 - イルオキシ)ピリミジン 0.38 g (82%) を得た。

$^1H$ -NMR: [ $CDCl_3$ ] 3.85 (s, 3H), 4.00 (s, 3H), 6.24 (s, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.65 (s, 1H)。

10

【0060】

3 - メチル - 4 - トリフルオロメチルピラゾールの製造:

トルエン 100 ml 中の 4, 4, 4 - トロフルオロブタン - 2 - オン 15 g (119ミリモル) 及び  $N, N$  - ジメチルホルムアミドジメチルアセタール 28.3 g (238ミリモル) の溶液を還流下に 8 時間攪拌した。その後、混合物を蒸発させて乾燥した。粗生成物をエタノール 100 ml 中に取り、ヒドラジン水和物 18.45 ml を添加し、その後、混合物を還流下 8 時間攪拌し、再濃縮した。ヘプタン/酢酸エチル (3 : 7) を使用したシリカゲル上のクロマトグラフ精製により、3 - メチル - 4 - トリフルオロメチルピラゾール 5.4 g (31%) を得た。

$^1H$ -NMR: [ $CDCl_3$ ] 2.40 (s, 3H), 7.75 (s, 1H)。

20

【0061】

以下の表に掲げる実施例は上述した方法と同様の方法で製造され、または上述した方法と同様の方法で得ることができる。

【0062】

本明細書で使用される省略形は以下の定義を有する:

$Et$  = エチル;  $OEt$  = エトキシ;  $Me$  = メチル;  $OMe$  = メトキシ;  $EA$  = 酢酸エチル;  $m.p.$  = 融点;  $R^f$  = 保持;  $i-Pr$  = イソプロピル;  $n-Pr$  =  $n$  - プロピル;  $RT$  = 室温。

【0063】

【表 1】

表 1 : 置換基及び記号が以下に定義される本発明の式 (I) の化合物 :

Y = Y 1

R<sup>6</sup> = H

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
1.1	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 7.43 (dd, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.75 (d, 1H), 8.78 (s, 1H) 8.80 (d, 1H)
1.2	H	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	
1.3	H	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
1.4	H	H	H	H	Cl	
1.5	H	H	Me	H	Cl	
1.6	H	H	H	Me	Cl	
1.7	H	H	H	H	CN	
1.8	H	H	Me	H	CN	
1.9	H	H	H	Me	CN	
1.10	H	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
1.11	H	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
1.12	H	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
1.13	Me	H	H	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.60 (s, 3H), 7.43 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.70 (s, 1H), 8.80 (d, 1H)
1.14	Me	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.45 (s, 3H), 2.59 (s, 3H), 7.40 (dd, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.66 (d, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.78 (d, 1H)
1.15	Me	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
1.16	Me	H	H	H	Cl	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.60 (s, 3H), 7.16 (dd, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.66 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.70 (s, 1H)
1.17	Me	H	Me	H	Cl	
1.18	Me	H	H	Me	Cl	
1.19	Me	H	H	H	CN	

10

20

30

40

【表 2】

(表 1 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
1.20	Me	H	Me	H	CN	
1.21	Me	H	H	Me	CN	
1.22	Me	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.60 (s, 3H), 6.82 (d, 1H), 7.03 (dd, 1H), 7.53 (t, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.25 (d, 1H), 8.70 (s, 1H)
1.23	Me	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
1.24	Me	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
1.25	Et	H	H	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.35 (t, 3H), 2.85 (q, 2H), 7.45 (dd, 1H), 7.70 (s, 2H), 7.95 (s, 1H), 8.00 (d, 1H), 8.70 (s, 1H)
1.26	Et	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.35 (t, 3H), 2.45 (s, 3H), 2.84 (q, 2H), 7.41 (dd, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.70 (d, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.78 (d, 1H)
1.27	Et	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
1.28	Et	H	H	H	Cl	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.40 (t, 3H), 2.92 (q, 2H), 7.23 (dd, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.72 (s, 1H), 8.02 (s, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.88 (s, 1H)
1.29	Et	H	Me	H	Cl	
1.30	Et	H	H	Me	Cl	
1.31	Et	H	H	H	CN	
1.32	Et	H	Me	H	CN	
1.33	Et	H	H	Me	CN	
1.34	Et	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
1.35	Et	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
1.36	Et	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
1.37	OMe	H	H	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 4.00 (s, 3H), 7.15 (s, 1H), 7.42 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.92 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.80 (d, 1H)
1.38	OMe	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.40 (s, 1H), 3.98 (s, 3H), 7.08 (s, 1H), 7.42 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 8.50

10

20

30

40

【表 3】

(表 1 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
						(s, 1H), 8.80 (d, 1H)
1.39	OMe	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
1.40	OMe	H	H	H	Cl	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 4.00 (s, 3H), 7.13 (s, 1H), 7.18 (dd, 1H), 7.34 (d, 1H), 7.94 (s, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.60 (s, 1H)
1.41	OMe	H	Me	H	Cl	
1.42	OMe	H	H	Me	Cl	
1.43	OMe	H	H	H	CN	
1.44	OMe	H	Me	H	CN	
1.45	OMe	H	H	Me	CN	
1.46	OMe	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 4.00 (s, 3H), 6.85 (d, 1H), 7.05 (dd, 1H), 7.12 (s, 1H), 7.55 (t, 1H), 7.92 (s, 1H), 8.25 (d, 1H), 8.60 (s, 1H)
1.47	OMe	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
1.48	OMe	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
1.49	Cl	H	H	H	CF <sub>3</sub>	
1.50	Cl	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	
1.51	Cl	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
1.52	Cl	H	H	H	Cl	
1.53	Cl	H	Me	H	Cl	
1.54	Cl	H	H	Me	Cl	
1.55	Cl	H	H	H	CN	
1.56	Cl	H	Me	H	CN	
1.57	Cl	H	H	Me	CN	
1.58	Cl	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
1.59	Cl	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
1.60	Cl	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
1.61	CN	H	H	H	CF <sub>3</sub>	

10

20

30

40

【表 4】

(表 1 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
1.62	CN	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	
1.63	CN	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
1.64	CN	H	H	H	Cl	
1.65	CN	H	Me	H	Cl	
1.66	CN	H	H	Me	Cl	
1.67	CN	H	H	H	CN	
1.68	CN	H	Me	H	CN	
1.69	CN	H	H	Me	CN	
1.70	CN	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
1.71	CN	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
1.72	CN	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
1.73	H	H	H	H	CF <sub>2</sub> H	
1.74	Me	H	Me	H	CF <sub>2</sub> H	
1.75	Me	H	H	Me	CF <sub>2</sub> H	
1.76	Me	H	H	H	CF <sub>2</sub> H	
1.77	Et	H	H	H	CF <sub>2</sub> H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.35 (t, 3H), 2.86 (q, 2H), 6.70 (t, 1H), 7.35 (dd, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.70 (s, 1H), 8.72 (d, 1H)
1.78	Et	H	Me	H	CF <sub>2</sub> H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.35 (t, 3H), 2.45 (s, 3H), 2.84 (q, 2H), 6.70 (t, 1H), 7.35 (dd, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.70 (d, 1H)
1.79	Et	H	H	Me	CF <sub>2</sub> H	
1.80	OMe	H	H	H	CF <sub>2</sub> H	
1.81	OMe	H	Me	H	CF <sub>2</sub> H	
1.82	OMe	H	H	Me	CF <sub>2</sub> H	
1.83	OH	H	H	H	CF <sub>3</sub>	
1.84	OH	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	

10

20

30

40

【表 5】

(表 1 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
1.85	OH	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
1.86	OH	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
1.87	OH	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
1.88	OH	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
1.89	OH	H	H	H	CF <sub>2</sub> H	
1.90	OH	H	Me	H	CF <sub>2</sub> H	
1.91	OH	H	H	Me	CF <sub>2</sub> H	
1.92	n-Pr	H	H	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.00 (t, 3H), 1.80 (m, 2H), 2.80 (t, 2H), 7.42 (dd, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.70 (s, 1H), 8.80 (d, 1H)
1.93	n-Pr	H	H	H	Cl	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.00 (t, 3H), 1.80 (m, 2H), 2.80 (t, 2H), 7.18 (dd, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.70 (s, 1H)
1.94	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 7.50 (dd, 1H), 7.72 (d, 1H), 8.05 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.75 (s, 1H), 8.83 (d, 1H)
1.95	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.25 (m, 2H), 3.05 (t, 2H), 3.40 (t, 2H), 7.40 (dd, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.72 (s, 1H), 8.78 (s, 1H)

10

20

30

【 0 0 6 8 】

【表 6】

表 2 : 置換基及び記号が以下に定義される本発明の式 (I) の化合物 :

No.	Y = Y <sub>2</sub>			R <sup>2</sup> = H		R <sup>6</sup> = H		物理的データ
	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>		
2.1	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 7.42 (m, 1H), 7.55 (m, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.65 (d, 1H), 8.70 (s, 1H)	
2.2	H	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	H		
2.3	H	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	H		
2.4	H	H	H	H	Cl	H		
2.5	H	H	Me	H	Cl	H		
2.6	H	H	H	Me	Cl	H		
2.7	H	H	H	H	CN	H		
2.8	H	H	Me	H	CN	H		
2.9	H	H	H	Me	CN	H		
2.10	H	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	H		
2.11	H	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	H		
2.12	H	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	H		
2.13	Me	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.60 (s, 3H), 7.28 (s, 1H), 7.45 (m, 1H), 7.60 (m, 3H), 7.95 (s, 1H), 8.60 (s, 1H)	
2.14	Me	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	H		
2.15	Me	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	H		
2.16	Me	H	H	H	Cl	H		
2.17	Me	H	Me	H	Cl	H		
2.18	Me	H	H	Me	Cl	H		
2.19	Me	H	H	H	CN	H		
2.20	Me	H	Me	H	CN	H		
2.21	Me	H	H	Me	CN	H		
2.22	Me	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	H		

10

20

30

40



【表 7】  
(表 2 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	物理的データ
2.23	Me	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	H	
2.24	Me	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	H	
2.25	Et	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	
2.26	Et	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.30 (t, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.80 (q, 2H), 7.42 (m, 1H), 7.58 (m, 3H), 8.50 (s, 1H)
2.27	Et	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	H	
2.28	Et	H	H	H	Cl	H	
2.29	Et	H	Me	H	Cl	H	
2.30	Et	H	H	Me	Cl	H	
2.31	Et	H	H	H	CN	H	
2.32	Et	H	Me	H	CN	H	
2.33	Et	H	H	Me	CN	H	
2.34	Et	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	H	
2.35	Et	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	H	
2.36	Et	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	H	
2.37	OMe	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 3.85 (s, 3H), 6.97 (s, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.50 (m, 3H), 7.80 (s, 1H), 8.44 (s, 1H)
2.38	OMe	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.40 (s, 3H), 3.94 (s, 3H), 7.00 (s, 1H), 7.42 (m, 1H), 7.56 (m, 3H), 8.43 (s, 1H)
2.39	OMe	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	H	
2.40	OMe	H	H	H	Cl	H	
2.41	OMe	H	Me	H	Cl	H	
2.42	OMe	H	H	Me	Cl	H	
2.43	OMe	H	H	H	CN	H	
2.44	OMe	H	Me	H	CN	H	
2.45	OMe	H	H	Me	CN	H	

10

20

30

40

【表 8】

(表 2 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	物理的データ
2.46	OMe	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	H	
2.47	OMe	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	H	
2.48	OMe	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	H	
2.49	Cl	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	
2.50	Cl	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	H	
2.51	Cl	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	H	
2.52	Cl	H	H	H	Cl	H	
2.53	Cl	H	Me	H	Cl	H	
2.54	Cl	H	H	Me	Cl	H	
2.55	Cl	H	H	H	CN	H	
2.56	Cl	H	Me	H	CN	H	
2.57	Cl	H	H	Me	CN	H	
2.58	Cl	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	H	
2.59	Cl	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	H	
2.60	Cl	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	H	
2.61	CN	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	
2.62	CN	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	H	
2.63	CN	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	H	
2.64	CN	H	H	H	Cl	H	
2.65	CN	H	Me	H	Cl	H	
2.66	CN	H	H	Me	Cl	H	
2.67	CN	H	H	H	CN	H	
2.68	CN	H	Me	H	CN	H	
2.69	CN	H	H	Me	CN	H	
2.70	CN	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	H	
2.71	CN	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	H	
2.72	CN	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	H	

10

20

30

40

【表 9】

(表 2 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	物理的データ
2.73	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 7.45 (m, 1H), 7.60 (m, 3H), 7.70 (d, 1H), 8.00 (s, 1H), 8.05 (s, 1H), 8.63 (s, 1H)
2.74	n-Pr	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.00 (t, 3H), 2.80 (m, 2H), 2.78 (t, 2H), 7.42 (m, 1H), 7.58 (m, 3H), 7.95 (s, 1H), 8.60 (s, 1H)
2.75	n-Pr	H	H	H	CF <sub>3</sub>	4-F	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.00 (t, 3H), 2.80 (m, 2H), 2.76 (t, 2H), 7.28 (m, 1H), 7.42 (m, 1H), 7.53 (m, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.63 (s, 1H)
2.76	Et	H	H	H	CF <sub>3</sub>	4-F	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.30 (t, 3H), 2.80 (q, 4H), 7.30 (m, 1H), 7.42 (m, 1H), 7.52 (m, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.94 (s, 1H)
2.77	Et	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	4-F	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.30 (t, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.80 (q, 2H), 7.28 (m, 1H), 7.40 (m, 1H), 7.55 (m, 1H), 7.55 (s, 1H), 8.55 (s, 1H)
2.78	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	H	CF <sub>3</sub>	H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.20 (m, 2H), 3.00 (t, 2H), 3.40 (t, 2H), 7.42 (m, 1H), 7.55 (m, 3H), 7.92 (s, 1H), 8.60 (s, 1H)

10

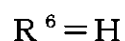
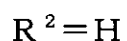
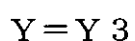
20

30

【 0 0 7 2 】

【表 10】

表 3 : 置換基及び記号が以下に定義される本発明の式 (I) の化合物 :



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
3.1	H	H	H	CF <sub>3</sub>	
3.2	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	
3.3	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
3.4	H	H	H	Cl	
3.5	H	Me	H	Cl	
3.6	H	H	Me	Cl	
3.7	H	H	H	CN	
3.8	H	Me	H	CN	
3.9	H	H	Me	CN	
3.10	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
3.11	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
3.12	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
3.13	Me	H	H	CF <sub>3</sub>	
3.14	Me	Me	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.55 (s, 3H), 7.35 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.03 (dd, 1H), 8.62 (s, 1H)
3.15	Me	H	Me	CF <sub>3</sub>	
3.16	Me	H	H	Cl	
3.17	Me	Me	H	Cl	
3.18	Me	H	Me	Cl	
3.19	Me	H	H	CN	
3.20	Me	Me	H	CN	
3.21	Me	H	Me	CN	
3.22	Me	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
3.23	Me	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	

10

20

30

40

【表 1 1】

(表 3 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
3.24	Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
3.25	Et	H	H	CF <sub>3</sub>	
3.26	Et	Me	H	CF <sub>3</sub>	
3.27	Et	H	Me	CF <sub>3</sub>	
3.28	Et	H	H	Cl	
3.29	Et	Me	H	Cl	
3.30	Et	H	Me	Cl	
3.31	Et	H	H	CN	
3.32	Et	Me	H	CN	
3.33	Et	H	Me	CN	
3.34	Et	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
3.35	Et	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
3.36	Et	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
3.37	OMe	H	H	CF <sub>3</sub>	
3.38	OMe	Me	H	CF <sub>3</sub>	
3.39	OMe	H	Me	CF <sub>3</sub>	
3.40	OMe	H	H	Cl	
3.41	OMe	Me	H	Cl	
3.42	OMe	H	Me	Cl	
3.43	OMe	H	H	CN	
3.44	OMe	Me	H	CN	
3.45	OMe	H	Me	CN	
3.46	OMe	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
3.47	OMe	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
3.48	OMe	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
3.49	Cl	H	H	CF <sub>3</sub>	
3.50	Cl	Me	H	CF <sub>3</sub>	

10

20

30

40

【表 1 2】

(表 3 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
3.51	Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>	
3.52	Cl	H	H	Cl	
3.53	Cl	Me	H	Cl	
3.54	Cl	H	Me	Cl	
3.55	Cl	H	H	CN	
3.56	Cl	Me	H	CN	
3.57	Cl	H	Me	CN	
3.58	Cl	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
3.59	Cl	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
3.60	Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
3.61	CN	H	H	CF <sub>3</sub>	
3.62	CN	Me	H	CF <sub>3</sub>	
3.63	CN	H	Me	CF <sub>3</sub>	
3.64	CN	H	H	Cl	
3.65	CN	Me	H	Cl	
3.66	CN	H	Me	Cl	
3.67	CN	H	H	CN	
3.68	CN	Me	H	CN	
3.69	CN	H	Me	CN	
3.70	CN	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
3.71	CN	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
3.72	CN	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	

10

20

30

40

【 0 0 7 5 】

【表 1 3】

表 4 : 置換基及び記号が以下に定義される本発明の式 (I) の化合物 :

$$Y = Y_4$$

$$R^2 = H$$

$$R^6 = H$$

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
4.1	H	H	H	CF <sub>3</sub>	
4.2	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	
4.3	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
4.4	H	H	H	Cl	
4.5	H	Me	H	Cl	
4.6	H	H	Me	Cl	
4.7	H	H	H	CN	
4.8	H	Me	H	CN	
4.9	H	H	Me	CN	
4.10	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
4.11	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
4.12	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
4.13	Me	H	H	CF <sub>3</sub>	
4.14	Me	Me	H	CF <sub>3</sub>	
4.15	Me	H	Me	CF <sub>3</sub>	
4.16	Me	H	H	Cl	
4.17	Me	Me	H	Cl	
4.18	Me	H	Me	Cl	
4.19	Me	H	H	CN	
4.20	Me	Me	H	CN	
4.21	Me	H	Me	CN	
4.22	Me	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
4.23	Me	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
4.24	Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
4.25	Et	H	H	CF <sub>3</sub>	
4.26	Et	Me	H	CF <sub>3</sub>	
4.27	Et	H	Me	CF <sub>3</sub>	
4.28	Et	H	H	Cl	
4.29	Et	Me	H	Cl	

10

20

30

40

【表 1 4】

(表 4 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
4.30	Et	H	Me	Cl	
4.31	Et	H	H	CN	
4.32	Et	Me	H	CN	
4.33	Et	H	Me	CN	
4.34	Et	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
4.35	Et	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
4.36	Et	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
4.37	OMe	H	H	CF <sub>3</sub>	
4.38	OMe	Me	H	CF <sub>3</sub>	
4.39	OMe	H	Me	CF <sub>3</sub>	
4.40	OMe	H	H	Cl	
4.41	OMe	Me	H	Cl	
4.42	OMe	H	Me	Cl	
4.43	OMe	H	H	CN	
4.44	OMe	Me	H	CN	
4.45	OMe	H	Me	CN	
4.46	OMe	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
4.47	OMe	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
4.48	OMe	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
4.49	Cl	H	H	CF <sub>3</sub>	
4.50	Cl	Me	H	CF <sub>3</sub>	
4.51	Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>	
4.52	Cl	H	H	Cl	
4.53	Cl	Me	H	Cl	
4.54	Cl	H	Me	Cl	
4.55	Cl	H	H	CN	
4.56	Cl	Me	H	CN	
4.57	Cl	H	Me	CN	
4.58	Cl	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
4.59	Cl	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
4.60	Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
4.61	CN	H	H	CF <sub>3</sub>	

10

20

30

40



【表 1 5】

(表 4 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
4.62	CN	Me	H	CF <sub>3</sub>	
4.63	CN	H	Me	CF <sub>3</sub>	
4.64	CN	H	H	Cl	
4.65	CN	Me	H	Cl	
4.66	CN	H	Me	Cl	
4.67	CN	H	H	CN	
4.68	CN	Me	H	CN	
4.69	CN	H	Me	CN	
4.70	CN	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
4.71	CN	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
4.72	CN	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	

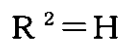
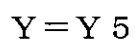
10

20

【 0 0 7 8 】

【表 1 6】

表 5 : 置換基及び記号が以下に定義される本発明の式 (I) の化合物 :



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物理的データ
5.1	H	H	H	
5.2	H	Me	H	
5.3	H	H	Me	
5.4	H	H	H	
5.5	H	Me	H	
5.6	H	H	Me	
5.7	H	H	H	
5.8	H	Me	H	
5.9	H	H	Me	
5.10	H	H	H	
5.11	H	Me	H	
5.12	H	H	Me	
5.13	Me	H	H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.58 (s, 3H), 7.03 (m, 2H), 7.15 (m, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 8.62 (s, 1H)
5.14	Me	Me	H	
5.15	Me	H	Me	
5.16	Me	H	H	
5.17	Me	Me	H	
5.18	Me	H	Me	
5.19	Me	H	H	
5.20	Me	Me	H	
5.21	Me	H	Me	
5.22	Me	H	H	
5.23	Me	Me	H	
5.24	Me	H	Me	
5.25	Et	H	H	
5.26	Et	Me	H	
5.27	Et	H	Me	
5.28	Et	H	H	

10

20

30

40

【表 17】

(表5 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物理的データ
5.30	Et	H	Me	
5.31	Et	H	H	
5.32	Et	Me	H	
5.33	Et	H	Me	
5.34	Et	H	H	
5.35	Et	Me	H	
5.36	Et	H	Me	
5.37	OMe	H	H	
5.38	OMe	Me	H	
5.39	OMe	H	Me	
5.40	OMe	H	H	
5.41	OMe	Me	H	
5.42	OMe	H	Me	
5.43	OMe	H	H	
5.44	OMe	Me	H	
5.45	OMe	H	Me	
5.46	OMe	H	H	
5.47	OMe	Me	H	
5.48	OMe	H	Me	
5.49	Cl	H	H	
5.50	Cl	Me	H	
5.51	Cl	H	Me	
5.52	Cl	H	H	
5.53	Cl	Me	H	
5.54	Cl	H	Me	
5.55	Cl	H	H	
5.56	Cl	Me	H	
5.57	Cl	H	Me	
5.58	Cl	H	H	
5.59	Cl	Me	H	
5.60	Cl	H	Me	
5.61	CN	H	H	

10

20

30

40

【表 1 8】  
(表 5 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	物理的データ
5.62	CN	Me	H	
5.63	CN	H	Me	
5.64	CN	H	H	
5.65	CN	Me	H	
5.66	CN	H	Me	
5.67	CN	H	H	
5.68	CN	Me	H	
5.69	CN	H	Me	
5.70	CN	H	H	
5.71	CN	Me	H	
5.72	CN	H	Me	

10

20

【 0 0 8 1 】

【表 19】

表 6 : 置換基及び記号が以下に定義される本発明の式 (I) の化合物 :

Y = Y 6

R<sup>2</sup>, R<sup>6</sup> = HR<sup>7</sup> = E t

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
6.1	H	H	H	CF <sub>3</sub>	
6.2	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	
6.3	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
6.4	H	H	H	Cl	
6.5	H	Me	H	Cl	
6.6	H	H	Me	Cl	
6.7	H	H	H	CN	
6.8	H	Me	H	CN	
6.9	H	H	Me	CN	
6.10	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
6.11	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
6.12	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
6.13	Me	H	H	CF <sub>3</sub>	
6.14	Me	Me	H	CF <sub>3</sub>	
6.15	Me	H	Me	CF <sub>3</sub>	
6.16	Me	H	H	Cl	
6.17	Me	Me	H	Cl	
6.18	Me	H	Me	Cl	
6.19	Me	H	H	CN	
6.20	Me	Me	H	CN	
6.21	Me	H	Me	CN	
6.22	Me	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
6.23	Me	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
6.24	Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
6.25	Et	H	H	CF <sub>3</sub>	
6.26	Et	Me	H	CF <sub>3</sub>	
6.27	Et	H	Me	CF <sub>3</sub>	
6.28	Et	H	H	Cl	
6.29	Et	Me	H	Cl	

10

20

30

40

【表 2 0】

(表 6 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
6.30	Et	H	Me	Cl	
6.31	Et	H	H	CN	
6.32	Et	Me	H	CN	
6.33	Et	H	Me	CN	
6.34	Et	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
6.35	Et	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
6.36	Et	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
6.37	OMe	H	H	CF <sub>3</sub>	
6.38	OMe	Me	H	CF <sub>3</sub>	
6.39	OMe	H	Me	CF <sub>3</sub>	
6.40	OMe	H	H	Cl	
6.41	OMe	Me	H	Cl	
6.42	OMe	H	Me	Cl	
6.43	OMe	H	H	CN	
6.44	OMe	Me	H	CN	
6.45	OMe	H	Me	CN	
6.46	OMe	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
6.47	OMe	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
6.48	OMe	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
6.49	Cl	H	H	CF <sub>3</sub>	
6.50	Cl	Me	H	CF <sub>3</sub>	
6.51	Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>	
6.52	Cl	H	H	Cl	
6.53	Cl	Me	H	Cl	
6.54	Cl	H	Me	Cl	
6.55	Cl	H	H	CN	
6.56	Cl	Me	H	CN	
6.57	Cl	H	Me	CN	
6.58	Cl	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
6.59	Cl	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
6.60	Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
6.61	CN	H	H	CF <sub>3</sub>	

10

20

30

40

【表 2 1】

(表 6 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
6.62	CN	Me	H	CF <sub>3</sub>	
6.63	CN	H	Me	CF <sub>3</sub>	
6.64	CN	H	H	Cl	
6.65	CN	Me	H	Cl	
6.66	CN	H	Me	Cl	
6.67	CN	H	H	CN	
6.68	CN	Me	H	CN	
6.69	CN	H	Me	CN	
6.70	CN	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
6.71	CN	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
6.72	CN	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
6.73	Me	H	H	CF <sub>2</sub> H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.50 (t, 3H), 2.58 (s, 3H), 4.25 (q, 2H), 6.25 (s, 1H), 6.75 (t, 1H), 7.59 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.70 (s, 1H)

10

20

【 0 0 8 4 】

【表 2 2】

表 7 : 置換基及び記号が以下に定義される本発明の式 (I) の化合物 :

Y = Y 7

R<sup>6</sup> = H

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
7.1	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	
7.2	H	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	
7.3	H	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
7.4	H	H	H	H	Cl	
7.5	H	H	Me	H	Cl	
7.6	H	H	H	Me	Cl	
7.7	H	H	H	H	CN	
7.8	H	H	Me	H	CN	
7.9	H	H	H	Me	CN	
7.10	H	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
7.11	H	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
7.12	H	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
7.13	Me	H	H	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.60 (s, 3H), 7.36 (d, 2H), 7.45 (m, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 8.70 (s, 1H)
7.14	Me	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	
7.15	Me	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
7.16	Me	H	H	H	Cl	
7.17	Me	H	Me	H	Cl	
7.18	Me	H	H	Me	Cl	
7.19	Me	H	H	H	CN	
7.20	Me	H	Me	H	CN	
7.21	Me	H	H	Me	CN	
7.22	Me	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
7.23	Me	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	

10

20

30

40



【表 2 3】

(表 7 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
7.24	Me	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
7.25	Et	H	H	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.35 (t, 3H), 2.87 (q, 2H), 7.37 (d, 1H), 7.48 (m, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 8.70 (s, 1H)
7.26	Et	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.35 (t, 3H), 2.43 (s, 2H), 2.83 (q, 2H), 7.36 (d, 1H), 7.46 (m, 1H), 7.57 (s, 1H), 8.60 (s, 1H)
7.27	Et	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
7.28	Et	H	H	H	Cl	
7.29	Et	H	Me	H	Cl	
7.30	Et	H	H	Me	Cl	
7.31	Et	H	H	H	CN	
7.32	Et	H	Me	H	CN	
7.33	Et	H	H	Me	CN	
7.34	Et	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
7.35	Et	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
7.36	Et	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
7.37	OMe	H	H	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 4.00 (s, 3H), 7.05 (s, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.45 (m, 1H), 7.90 (s, 1H), 8.60 (s, 1H)
7.38	OMe	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	
7.39	OMe	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
7.40	OMe	H	H	H	Cl	
7.41	OMe	H	Me	H	Cl	
7.42	OMe	H	H	Me	Cl	
7.43	OMe	H	H	H	CN	
7.44	OMe	H	Me	H	CN	
7.45	OMe	H	H	Me	CN	
7.46	OMe	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	

10

20

30

40

【表 2 4】

(表 7 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
7.47	OMe	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
7.48	OMe	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
7.49	Cl	H	H	H	CF <sub>3</sub>	
7.50	Cl	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	
7.51	Cl	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
7.52	Cl	H	H	H	Cl	
7.53	Cl	H	Me	H	Cl	
7.54	Cl	H	H	Me	Cl	
7.55	Cl	H	H	H	CN	
7.56	Cl	H	Me	H	CN	
7.57	Cl	H	H	Me	CN	
7.58	Cl	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
7.59	Cl	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
7.60	Cl	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
7.61	CN	H	H	H	CF <sub>3</sub>	
7.62	CN	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	
7.63	CN	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
7.64	CN	H	H	H	Cl	
7.65	CN	H	Me	H	Cl	
7.66	CN	H	H	Me	Cl	
7.67	CN	H	H	H	CN	
7.68	CN	H	Me	H	CN	
7.69	CN	H	H	Me	CN	
7.70	CN	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
7.71	CN	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
7.72	CN	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	

10

20

30

40

【表 2 5】

(表 7 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
7.73	n-Pr	H	H	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.00 (t, 3H), 2.43 (s, 1H), 2.80 (t, 2H), 7.38 (d, 1H), 7.46 (m, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 8.72 (s, 1H)
7.74	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>			Me	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.20 (m, 2H), 3.06 (t, 2H), 3.40 (t, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.43 (m, 1H), 7.97 (s, 1H), 8.73 (s, 1H)

10

【 0 0 8 8 】

【表 2 6】

表 8 : 置換基及び記号が以下に定義される本発明の式 (I) の化合物 :

Y = Y 8

R<sup>2</sup> = HR<sup>6</sup> = H

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
8.1	H	H	H	CF <sub>3</sub>	
8.2	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	
8.3	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
8.4	H	H	H	Cl	
8.5	H	Me	H	Cl	
8.6	H	H	Me	Cl	
8.7	H	H	H	CN	
8.8	H	Me	H	CN	
8.9	H	H	Me	CN	
8.10	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
8.11	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
8.12	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
8.13	Me	H	H	CF <sub>3</sub>	
8.14	Me	Me	H	CF <sub>3</sub>	
8.15	Me	H	Me	CF <sub>3</sub>	
8.16	Me	H	H	Cl	
8.17	Me	Me	H	Cl	
8.18	Me	H	Me	Cl	
8.19	Me	H	H	CN	
8.20	Me	Me	H	CN	
8.21	Me	H	Me	CN	
8.22	Me	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
8.23	Me	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
8.24	Me	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
8.25	Et	H	H	CF <sub>3</sub>	
8.26	Et	Me	H	CF <sub>3</sub>	
8.27	Et	H	Me	CF <sub>3</sub>	
8.28	Et	H	H	Cl	
8.29	Et	Me	H	Cl	

10

20

30

40

【 0 0 8 9 】

【表 27】

(表 8 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
8.30	Et	H	Me	Cl	
8.31	Et	H	H	CN	
8.32	Et	Me	H	CN	
8.33	Et	H	Me	CN	
8.34	Et	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
8.35	Et	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
8.36	Et	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
8.37	OMe	H	H	CF <sub>3</sub>	
8.38	OMe	Me	H	CF <sub>3</sub>	
8.39	OMe	H	Me	CF <sub>3</sub>	
8.40	OMe	H	H	Cl	
8.41	OMe	Me	H	Cl	
8.42	OMe	H	Me	Cl	
8.43	OMe	H	H	CN	
8.44	OMe	Me	H	CN	
8.45	OMe	H	Me	CN	
8.46	OMe	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
8.47	OMe	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
8.48	OMe	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
8.49	Cl	H	H	CF <sub>3</sub>	
8.50	Cl	Me	H	CF <sub>3</sub>	
8.51	Cl	H	Me	CF <sub>3</sub>	
8.52	Cl	H	H	Cl	
8.53	Cl	Me	H	Cl	
8.54	Cl	H	Me	Cl	
8.55	Cl	H	H	CN	
8.56	Cl	Me	H	CN	
8.57	Cl	H	Me	CN	
8.58	Cl	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
8.59	Cl	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
8.60	Cl	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
8.61	CN	H	H	CF <sub>3</sub>	

10

20

30

40

【表 2 8】

(表 8 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
8.62	CN	Me	H	CF <sub>3</sub>	
8.63	CN	H	Me	CF <sub>3</sub>	
8.64	CN	H	H	Cl	
8.65	CN	Me	H	Cl	
8.66	CN	H	Me	Cl	
8.67	CN	H	H	CN	
8.68	CN	Me	H	CN	
8.69	CN	H	Me	CN	
8.70	CN	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
8.71	CN	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
8.72	CN	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	

10

20

【 0 0 9 1 】

【表 29】

表 9 : 置換基及び記号が以下に定義される本発明の式 (I) の化合物 :

Y = Y 9

R<sup>6</sup> = HR<sup>7</sup> = Me

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
9.1	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 3.85 (s, 3H), 6.46 (s, 1H), 7.83 (d, 1H), 8.00 (s, 1H), 8.70 (d, 1H), 8.80 (s, 1H)
9.2	H	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.45 (s, 3H), 3.85 (s, 3H), 6.45 (s, 1H), 7.78 (d, 1H), 8.65 (d, 1H), 8.70 (s, 1H)
9.3	H	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
9.4	H	H	H	H	Cl	
9.5	H	H	Me	H	Cl	
9.6	H	H	H	Me	Cl	
9.7	H	H	H	H	CN	
9.8	H	H	Me	H	CN	
9.9	H	H	H	Me	CN	
9.10	H	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
9.11	H	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
9.12	H	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
9.13	Me	H	H	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.60 (s, 3H), 3.85 (s, 3H), 6.47 (s, 1H), 7.95 (d, 1H), 8.75 (d, 1H)
9.14	Me	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.40 (s, 3H), 2.60 (s, 3H), 3.85 (s, 3H), 6.45 (s, 1H), 7.60 (s, 1H), 8.60 (s, 1H)
9.15	Me	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.52 (s, 3H), 2.60 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 6.35 (s, 1H), 7.72 (s, 1H), 7.82 (s, 1H)
9.16	Me	H	H	H	Cl	
9.17	Me	H	Me	H	Cl	
9.18	Me	H	H	Me	Cl	
9.19	Me	H	H	H	CN	
9.20	Me	H	Me	H	CN	
9.21	Me	H	H	Me	CN	

10

20

30

40

【表 3 0】  
(表 9 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
9.22	Me	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
9.23	Me	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
9.24	Me	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
9.25	Et	H	H	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.35 (t, 3H), 2.90 (q, 2H), 3.86 (s, 3H), 6.47 (s, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.96 (s, 1H), 8.75 (s, 1H)
9.26	Et	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.34 (t, 3H), 2.45 (s, 3H), 2.80 (q, 2H), 3.95 (s, 3H), 6.50 (s, 1H), 7.53 (s, 1H), 8.60 (s, 1H)
9.27	Et	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
9.28	Et	H	H	H	Cl	
9.29	Et	H	Me	H	Cl	
9.30	Et	H	H	Me	Cl	
9.31	Et	H	H	H	CN	
9.32	Et	H	Me	H	CN	
9.33	Et	H	H	Me	CN	
9.34	Et	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
9.35	Et	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
9.36	Et	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
9.37	OMe	H	H	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 3.85 (s, 3H), 4.00 (s, 3H), 6.42 (s, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.65 (s, 1H)
9.38	OMe	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	
9.39	OMe	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
9.40	OMe	H	H	H	Cl	
9.41	OMe	H	Me	H	Cl	
9.42	OMe	H	H	Me	Cl	
9.43	OMe	H	H	H	CN	
9.44	OMe	H	Me	H	CN	
9.45	OMe	H	H	Me	CN	
9.46	OMe	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
9.47	OMe	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	

10

20

30

40



【表 3 1】  
(表 9 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
9.48	OMe	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
9.49	Cl	H	H	H	CF <sub>3</sub>	
9.50	Cl	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	
9.51	Cl	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
9.52	Cl	H	H	H	Cl	
9.53	Cl	H	Me	H	Cl	
9.54	Cl	H	H	Me	Cl	
9.55	Cl	H	H	H	CN	
9.56	Cl	H	Me	H	CN	
9.57	Cl	H	H	Me	CN	
9.58	Cl	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
9.59	Cl	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
9.60	Cl	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
9.61	CN	H	H	H	CF <sub>3</sub>	
9.62	CN	H	Me	H	CF <sub>3</sub>	
9.63	CN	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	
9.64	CN	H	H	H	Cl	
9.65	CN	H	Me	H	Cl	
9.66	CN	H	H	Me	Cl	
9.67	CN	H	H	H	CN	
9.68	CN	H	Me	H	CN	
9.69	CN	H	H	Me	CN	
9.70	CN	H	H	H	OCF <sub>2</sub> H	
9.71	CN	H	Me	H	OCF <sub>2</sub> H	
9.72	CN	H	H	Me	OCF <sub>2</sub> H	
9.73	H	Et	H	H	CF <sub>2</sub> H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.35 (t, 3H), 2.90 (q, 2H), 3.82 (s, 3H), 6.40 (s, 1H), 6.63 (t, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.75 (s, 1H)
9.74	H	Et	Me	H	CF <sub>2</sub> H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.35 (t, 3H), 2.43 (s, 3H), 2.85 (q, 2H), 3.80 (s, 3H), 6.40 (s, 1H), 6.61 (t, 1H), 7.60 (s, 1H), 8.60 (s, 1H)

10

20

30

40

【表 3 2】  
(表 9 続き)

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
9.75	H	H	H	H	c-Pr	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 0.75 (m, 2H), 0.93 (m, 2H), 1.93 (m, 1H), 3.68 (s, 3H), 5.80 (s, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.68 (d, 1H), 8.00 (s, 1H)
9.76	H	Me	H	H	c-Pr	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 0.75 (m, 2H), 0.92 (m, 2H), 1.92 (m, 1H), 2.60 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 5.80 (s, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.70 (s, 1H)
9.77	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.20 (m, 2H), 3.05 (t, 2H), 3.40 (t, 2H), 3.97 (s, 3H), 6.50 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.80 (s, 1H)

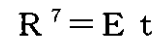
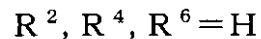
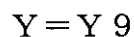
10

【 0 0 9 5 】

20

【表 3 3】

表 1 0 : 置換基及び記号が以下に定義される本発明の式 ( I ) の化合物 :



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	物理的データ
9.78	Me	H	CF <sub>2</sub> H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.60 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 6.40 (s, 1H), 6.64 (t, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.75 (s, 1H)
9.79	OMe	Me	CF <sub>2</sub> H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 2.43 (s, 3H), 3.85 (s, 3H), 4.00 (s, 3H), 6.42 (s, 1H), 7.08 (s, 1H), 8.55 (s, 1H)
9.80	OMe	H	CF <sub>2</sub> H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.45 (t, 3H), 4.00 (s, 3H), 4.15 (q, 2H), 6.35 (s, 1H), 6.62 (t, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.65 (s, 1H)
9.81	Et	H	CF <sub>2</sub> H	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.40 (t, 3H), 1.55 (t, 3H), 2.90 (q, 2H), 4.30 (q, 2H), 6.42 (s, 1H), 6.80 (t, 1H), 7.64 (s, 1H), 8.00 (s, 1H), 8.78 (s, 1H)
9.82	Me	H	CF <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H-NMR: δ [CDCl <sub>3</sub> ] 1.48 (t, 3H), 2.60 (s, 3H), 4.20 (q, 2H), 6.42 (s, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.75 (s, 1H)

30

40

【 0 0 9 6 】

B . 製剤実施例

1 . 粉剤

粉剤は式 ( I ) の化合物 1 0 質量部及び不活性物質としてタルク 9 0 質量部を混合し、

50

その混合物をハンマーミル中で粉砕することにより得た。

## 2. 分散性粉末

水中に速やかに分散する水和剤は式(I)の化合物25質量部、不活性物質としてカオリン含有石英64質量部、カリウムリグニンスルホネート10質量部並びに加湿剤及び分散剤としてナトリウムオレオイルメチルタウリド1質量部を混合し、その混合物をピンを有するディスクミル中で粉砕することにより得た。

## 3. 分散性製剤

水中に速やかに分散する分散性製剤は式(I)の化合物20質量部、アルキルフェノールポリグリコールエーテル(登録商標 Triton X207)6質量部、イソトリデカノールポリグリコールエーテル(8EO)3質量部及びパラフィン性鉱油(沸点範囲、例えば約255~277超)71質量部を混合し、そしてその混合物をボールミル中で5ミクロン未満の微粉度に粉砕することにより得た。

## 4. 乳剤

乳剤は式(I)の化合物15質量部、溶媒としてシクロヘキサノン75質量部及び乳化剤としてオキシエチル化ノニルフェノール10質量部から得た。

## 5. 水分散性粒剤

水分散性粒剤は式(I)の化合物75質量部、カルシウムリグニンスルホネート10質量部、ナトリウムラウリルスルホネート5質量部、ポリビニルアルコール3質量部及びカオリン7質量部を混合し、その混合物をピンを有するディスクミル中で粉砕し、その粉末を流動床中で粒状化液としての水上に噴霧することにより得た。

水分散性粒剤は、また、コロイドミル中で式(I)の化合物25質量部、ナトリウム2,2'-ジナフチルメタン-6,6'-ジスルホネート5質量部、ナトリウムオレオイルメチルタウリド2質量部、ポリビニルアルコール1質量部、炭酸カルシウム17質量部及び水50質量部を均質化し、そして前粉砕し、引き続いてその混合物をビードミル中で粉砕し、得られたその懸濁液を単一物質ノズルによってスプレータワー中で霧状化し、乾燥することにより得た。

## 【0097】

### C. 生物学の実施例

#### 1. 有害植物に対する発芽前除草作用

単子葉及び双子葉有害植物の種子をカードボードポット中の砂地ロームに蒔き、土壌で覆った。本発明の化合物は水和剤または乳剤の形状に製剤化され、その後、水性懸濁液または乳化液として、多数の添加量で600~800L/ha(変化させる)の施用率で土壌カバーの表面へ施用した。その処理の後、ポットを温室内におき、その雑草のための良好な生育条件下に保った。3~4週間の試験期間の後に発芽し、その後植物の損傷または発芽損傷を試験植物と未処理対照とを比較し視覚採点した。ここに、例えば実施例番号1.13、1.14、1.25、1.26、1.39及び1.46の本発明の化合物は1ヘクタール当たり活性物質1000g及び1000g未満の投薬量で、アマランスス レトロフレクスス(*Amaranthus retroflexus*)、ロリウム マルチフロラム(*Lolium multiflorum*)、セタリア ビリジス(*Setaria viridis*)及びステラリア メディア(*Stellaria media*)に対する100%の作用を示した。同じ投薬量で、例えば実施例番号7.13、9.13及び9.14の本発明の化合物は、アマランスス レトロフレクスス、セタリア ビリジス及びステラリア メディアに対して100%の作用を示した。

## 【0098】

#### 2. 有害植物に対する発芽後除草作用

単子葉及び双子葉有害植物の種子をカードボードポット中の砂地ロームに蒔き、土壌で覆い、良好な生育条件下温室内で生育した。播種後2~3週間、試験植物を三葉期に処理した。本発明の化合物は水和剤または乳剤として製剤化され、多数の投薬量で、600~800L/haの水施用率(変化させる)で緑色植物部分の表面上へ噴霧した。試験植物を最適な生育条件下に3~4週間温室内に放置した後、化合物の作用を採点した。ここに、

例えば1ヘクタール当たり活性物質1000g及び1000g未満の投薬量で、実施例番号1.46及び9.25の本発明の化合物はアマランスス レトロフレクスス、アベナ ファツア ( *Avena fatua* )、シナピス アルベンシス ( *Sinapis arvensis* ) 及びステラリア メディアに対して100%の作用を示した。

## 【 国際調査報告 】

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP2005/002049

<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b>		
IPC 7	A01N43/72 C07D403/04	A01N43/48 C07D403/14
	C07D417/14 C07D401/14	C07D409/14 C07D405/14
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
<b>B. FIELDS SEARCHED</b>		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)		
IPC 7 A01N C07D		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)		
EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data		
<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2004/013129 A (BAYER CROPSCIENCE GMBH; HOFFMANN, MICHAEL, GERHARD; HELMKE, HENDRIK; W) 12 February 2004 (2004-02-12) the whole document	1-11
A	WO 2004/013131 A (BAYER CROPSCIENCE GMBH; HOFFMANN, MICHAEL, GERHARD; HELMKE, HENDRIK; W) 12 February 2004 (2004-02-12) the whole document	1-11
A	WO 98/40379 A (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY; SELBY, THOMAS, P) 17 September 1998 (1998-09-17) cited in the application the whole document	1-11
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of box C. <input checked="" type="checkbox"/> Patent family members are listed in 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 document 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) *C* 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 *Z* document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
30 May 2005		06/06/2005
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 91 851 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer  Fritz, M

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2005/002049

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2004013129 A	12-02-2004	DE 10234876 A1	05-02-2004
		AU 2003281853 A1	23-02-2004
		CA 2493749 A1	12-02-2004
		WO 2004013129 A1	12-02-2004
		EP 1527067 A1	04-05-2005
		US 2004082475 A1	29-04-2004
WO 2004013131 A	12-02-2004	DE 10234875 A1	05-02-2004
		AU 2003250942 A1	23-02-2004
		CA 2494593 A1	12-02-2004
		WO 2004013131 A2	12-02-2004
		EP 1527069 A2	04-05-2005
		US 2004072692 A1	15-04-2004
WO 9840379 A	17-09-1998	AU 725548 B2	12-10-2000
		AU 6863898 A	29-09-1998
		BR 9815453 A	23-10-2001
		CA 2280515 A1	17-09-1998
		EP 0970072 A1	12-01-2000
		WO 9840379 A1	17-09-1998
		US 6172005 B1	09-01-2001

## INTERNATIONALER RESEARCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP2005/002049

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES IPK 7 A01N43/72 A01N43/48 C07D417/14 C07D409/14 C07D405/14 C07D403/04 C07D403/14 C07D401/14		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK		
B. RESEARCHIERTE GEBIETE Recherchiertes Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) IPK 7 A01N C07D		
Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 2004/013129 A (BAYER CROPSCIENCE GMBH; HOFFMANN, MICHAEL, GERHARD; HELMKE, HENDRIK; W) 12. Februar 2004 (2004-02-12) das ganze Dokument	1-11
A	WO 2004/013131 A (BAYER CROPSCIENCE GMBH; HOFFMANN, MICHAEL, GERHARD; HELMKE, HENDRIK; W) 12. Februar 2004 (2004-02-12) das ganze Dokument	1-11
A	WO 98/40379 A (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY; SELBY, THOMAS, P) 17. September 1998 (1998-09-17) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument	1-11
<input type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen <input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorie von angegebenen Veröffentlichungen : *A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist *E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist *L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) *C* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht *P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist *T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist *X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden ** Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist *&* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts
30. Mai 2005		06/06/2005
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 6818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax. (+31-70) 340-9016		Bevollmächtigter Beauftragter  Fritz, M

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/002049

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2004013129 A	12-02-2004	DE 10234876 A1	05-02-2004
		AU 2003281853 A1	23-02-2004
		CA 2493749 A1	12-02-2004
		WO 2004013129 A1	12-02-2004
		EP 1527067 A1	04-05-2005
		US 2004082475 A1	29-04-2004
WO 2004013131 A	12-02-2004	DE 10234875 A1	05-02-2004
		AU 2003250942 A1	23-02-2004
		CA 2494593 A1	12-02-2004
		WO 2004013131 A2	12-02-2004
		EP 1527069 A2	04-05-2005
		US 2004072692 A1	15-04-2004
WO 9840379 A	17-09-1998	AU 725548 B2	12-10-2000
		AU 6863898 A	29-09-1998
		BR 9815453 A	23-10-2001
		CA 2280515 A1	17-09-1998
		EP 0970072 A1	12-01-2000
		WO 9840379 A1	17-09-1998
		US 6172005 B1	09-01-2001



## フロントページの続き

(51) Int.Cl.		F I	テーマコード(参考)
<b>C 0 7 D 403/14</b>	<b>(2006.01)</b>	C 0 7 D 403/14	
<b>C 0 7 D 409/14</b>	<b>(2006.01)</b>	C 0 7 D 409/14	
<b>C 0 7 D 417/14</b>	<b>(2006.01)</b>	C 0 7 D 417/14	
<b>A 0 1 M 21/04</b>	<b>(2006.01)</b>	A 0 1 M 21/04	C
<b>A 0 1 H 5/00</b>	<b>(2006.01)</b>	A 0 1 H 5/00	A

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

- (72) 発明者 ヘンドリック・ヘルムケ  
ドイツ連邦共和国 6 5 8 5 3 リーダーバッハ・タウヌスシュトラッセ 4 9
- (72) 発明者 ロータール・ヴィルムス  
ドイツ連邦共和国 6 5 7 1 9 ホーフハイム・ケーニヒシュタイナーシュトラッセ 5 0
- (72) 発明者 トーマス・アウラー  
ドイツ連邦共和国 6 5 8 1 2 パートゾーデン・アム・タウヌス・ボナーシュトラッセ 1 5
- (72) 発明者 ハインツ・ケーネ  
ドイツ連邦共和国 6 5 7 1 9 ホーフハイム・イルティスヴェーク 7 a
- (72) 発明者 マーティン・ヒルズ  
ドイツ連邦共和国 6 5 7 1 9 ホーフハイム・アム・イーツェルグルント 5 b
- (72) 発明者 ディーター・フォイト  
ドイツ連邦共和国 6 5 7 6 0 エシュボルン・アム・ブルクグラベン 7 A
- F ターム(参考) 2B030 AA02 AD05 CA14  
2B121 AA19 CC05 EA26 EA27 FA06  
4C063 AA01 AA03 BB02 BB08 CC29 CC62 CC81 CC92 DD22 DD29  
EE03  
4H011 AB01 BB09 DD03 DD04