

(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 10 月 30 日(30.10.2014)



(10) 国際公開番号
WO 2014/175206 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 409/06 (2006.01) A01P 13/02 (2006.01)
A01N 47/04 (2006.01) C07D 409/14 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2014/061143
- (22) 国際出願日: 2014 年 4 月 21 日(21.04.2014)
- (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 2013-090755 2013 年 4 月 23 日(23.04.2013) JP
- (71) 出願人: 石原産業株式会社 (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD.) [JP/JP]; 〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目 3 番 1 5 号 Osaka (JP).
- (72) 発明者: 大野 研(OHNO, Ken); 〒5250025 滋賀県草津市西洪川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP). 大北 達哉(OKITA, Tatsuya); 〒5250025 滋賀県草津市西洪川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP). 小森 冴香(KOMORI, Sayaka); 〒5250025 滋賀県草津市西洪川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP). 田澤 優太(TAZAWA, Yuta); 〒5250025 滋賀県草津市西洪川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP). 熊倉 祐介(KUMAK-

URA, Yusuke); 〒5250025 滋賀県草津市西洪川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP). 堀谷 拓未(HORITANI, Takumi); 〒5250025 滋賀県草津市西洪川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP). 井櫻 賢二(IZAKURA, Kenji); 〒5250025 滋賀県草津市西洪川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP).

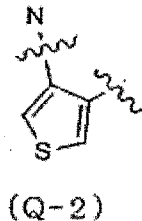
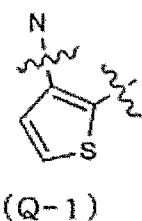
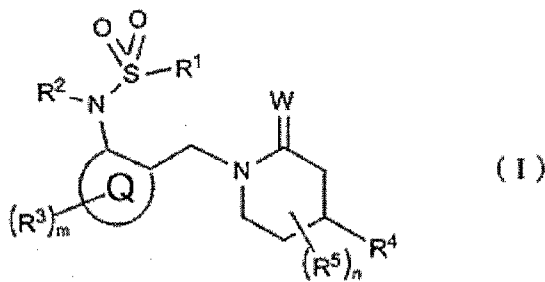
(74) 代理人: 特許業務法人 H A R A K E N Z O W O R L D P A T E N T & T R A D E M A R K (HARAKENZO WORLD PATENT & TRADE-MARK); 〒5300041 大阪府大阪市北区天神橋 2 丁目北 2 番 6 号 大和南森町ビル Osaka (JP).

(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.

[続葉有]

(54) Title: HETEROARYLSULFONAMIDE-TYPE COMPOUND OR SALT THEREOF

(54) 発明の名称: ヘテロアリールスルホンアミド系化合物又はその塩



る構造を有する。

(57) Abstract: Provided is a novel herbicide which can exhibit a significant herbicidal activity on undesirable plants. A heteroarylsulfonamide-type compound or a salt thereof has a structure represented by general formula (I) [wherein Q represents a thiophene ring represented by general formula (Q-1) or general formula (Q-2); W represents an oxygen atom or a sulfur atom; m represents an integer of 0 to 2; n represents an integer of 0 to 7; R¹ represents a halo-C₁-C₆ alkyl group; R² represents a hydrogen atom, a C₁-C₁₂ alkoxy carbonyl group or the like; R³ represents a halogen atom or a C₁-C₆ alkyl group; R⁴ represents a hydrogen atom, a halogen atom, a C₁-C₆ alkyl group or the like; and R⁵ represents a hydrogen atom, a halogen atom, a C₁-C₆ alkyl group or the like].

(57) 要約: 望ましくない植物への著しい除草活性を示す新規な除草剤を提供する。ヘテロアリールスルホンアミド系化合物又はその塩は、一般式 (I): [式中、Q は一般式 (Q-1) 又は一般式 (Q-2) で表されるチオフェン環であり; W は酸素原子又は硫黄原子であり; m は 0~2 の整数であり; n は 0~7 の整数であり; R¹ はハロ C₁-C₆ アルキルであり; R² は水素原子、C₁-C₁₂ アルコキシカルボニルなどであり; R³ はハロゲン原子又は C₁-C₆ アルキルであり; R⁴ は水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₆ アルキルなどであり; R⁵ は水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₆ アルキルなどである] で表され



(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, 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))

明 細 書

発明の名称：ヘテロアリールスルホンアミド系化合物又はその塩
技術分野

[0001] 本発明は、ヘテロアリールスルホンアミド系化合物又はその塩に関するものであり、より詳細には、除草剤の有効成分として有用な新規のヘテロアリールスルホンアミド系化合物又はその塩、並びにそれらを含む除草剤に関する。

背景技術

[0002] 下記特許文献1、特許文献2、特許文献3、特許文献4及び特許文献5には、一定の構造を有するハロアルキルスルホンアニリド誘導体が開示されている。しかしながら、それら特許文献には後述する一般式(I)で表されるヘテロアリールスルホンアミド系化合物は具体的には開示されていない。

先行技術文献

特許文献

- [0003] 特許文献1：日本国公開特許公報「特開2006-265240号」
特許文献2：日本国公開特許公報「特開2008-143895号」
特許文献3：国際公開公報「WO2010/026989号」
特許文献4：国際公開公報「WO2010/119906号」
特許文献5：国際公開公報「WO2013/061973号」

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0004] 従来から、雑草を防除する作業の省力化や農園芸用作物の生産性向上を図るため、雑草に対して優れた除草性能を有し、且つ栽培作物に対する安全性を有する除草剤が所望されている。これからの新しい除草剤の開発においては、その施用薬量を低く抑えつつも所望の除草効果を発揮することができる化合物の創出が希求されている。また、実用的な残効性を示しつつも必要以上に土壤中に残留したり、雨水などにより施用箇所以外の土壌へ有効成分が

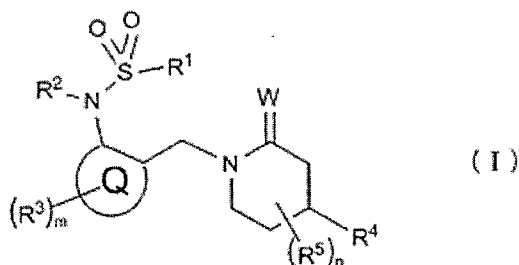
流出するなどして環境へ悪影響を及ぼしたりする恐れのない化合物の創出が希求されている。さらには、高い動物安全性を備えた化合物の創出が望まれている。しかし、そのような目的に適した新規化合物の探索は試行錯誤に頼っている。

課題を解決するための手段

[0005] 本発明者らは、前記課題を解決するような、より優れた除草剤を見出すべく種々検討した。その結果、新規なヘテロアリールスルホンアミド系化合物が、多様な雑草に低薬量で高い除草効果を示し、尚且つ各種有用作物に高い安全性を示すことを見出し、本発明を完成した。

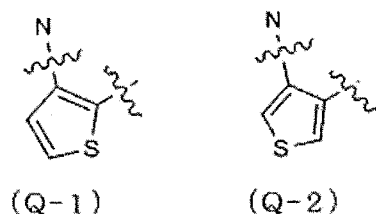
[0006] 即ち、本発明は、一般式 (I) :

[0007] [化1]



[0008] [式中、Qは一般式 (Q-1) 又は一般式 (Q-2) :

[0009] [化2]



[0010] で表されるチオフェン環であり；Wは酸素原子又は硫黄原子であり；mは0~2の整数であり；nは0~7の整数であり； R^1 はハロC₁-C₆アルキルであり； R^2 は水素原子、C₁-C₁₂アルコキシカルボニル、C₁-C₁₂アルキルカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルカルボニル、シクロC₃-C₆アルキルカルボニル、シクロC₃-C₆アルキルC₁-C₆アルキルカルボニル、C₂-C₆アルケニルカルボニル、Yで置換されてもよいフェニルC₂-C₆アルケニルカルボニル、Yで置換されてもよいフェニルカルボニル、

Yで置換されてもよい複素環カルボニル、ハロC₁-C₁₂アルコシカルボニル、C₁-C₆アルキルで置換されてもよいシクロC₃-C₆アルコシカルボニル、C₂-C₆アルケニルオシカルボニル、ハロC₂-C₆アルケニルオシカルボニル、C₂-C₆アルキニルオシカルボニル、C₁-C₆アルコシC₁-C₆アルコシカルボニル、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルコシカルボニル、C₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₆アルコシカルボニル、C₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₆アルコシカルボニル、Yで置換されてもよいフェニルC₁-C₆アルコシカルボニル、Yで置換されてもよいフェニルハロC₁-C₆アルコシカルボニル、Yで置換されてもよいフェノシカルボニル、Yで置換されてもよいフェノシC₁-C₆アルコシカルボニル、C₁-C₆アルキルチオカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルチオカルボニル、モノC₁-C₆アルキルアミノカルボニル、モノ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノカルボニル、窒素原子上の2つのC₁-C₆アルキルが互いに結合して3～8員環を形成してもよいジC₁-C₆アルキルアミノカルボニル、ジ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノカルボニル、C₁-C₆アルコシC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルコシカルボニルC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルコシオキサリル、C₁-C₆アルキルスルホニル、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル、Yで置換されてもよいフェニルスルホニル、Yで置換されてもよい複素環スルホニル、シクロC₃-C₆アルキルスルホニル、C₁-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよいフェニルC₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₁-C₆アルキルカルボニルオシC₁-C₆アルキル、シクロC₃-C₆アルキルカルボニルオシC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよいフェニルカルボニルオシC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよい複素環カルボニルオシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコシカルボニルオシC₁-C₆アルキル、シクロC₃-C₆アルコシカルボニルオシC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよいフェノシカルボニルオシC₁-C₆アルキル、モノC₁-C₆アルキルアミノカルボニルオシC₁-C₆アルキル、窒素原子上の2つのC₁-C₆アルキルが互いに結合して3～8員環を形成してもよいジC₁-C₆アルキルアミノカルボニルオシC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよいフェニルアミノカルボニルオシC₁-C₆アルキル又はYで置換されてもよいN-C₁-C₆アルキル-N-フェニルアミノカルボニルオ

キシC₁-C₆アルキルであり；R³はハロゲン原子又はC₁-C₆アルキルであり；R⁴は水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₁-C₆アルキルで置換されてもよいC₃-C₆シクロアルキル、ハロC₁-C₆アルキル、ハロC₃-C₆シクロアルキル、C₃-C₆シクロアルキルC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよいフェニル、Yで置換されてもよいフェニルC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルカルボニルオキシ、水酸基、C₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルコキシ、C₃-C₆アルケニルオキシ、C₃-C₆アルキニルオキシ、C₁-C₆アルキルチオ、ハロC₁-C₆アルキルチオ、C₁-C₆アルキルスルフィニル、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル、C₁-C₆アルキルスルホニル、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル、Yで置換されてもよいフェノキシ、Yで置換されてもよいフェニルチオ、Yで置換されてもよいフェニルスルフィニル、Yで置換されてもよいフェニルスルホニル、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₆アルコキシ、ヒドロキシC₁-C₆アルコキシ、モノ（C₁-C₆アルキル）アミノC₁-C₆アルコキシ、窒素原子上の2つのC₁-C₆アルキルが互いに結合して3～8員環を形成してもよいジ（C₁-C₆アルキル）アミノC₁-C₆アルコキシ、Yで置換されてもよいフェノキシC₁-C₆アルコキシ、Yで置換されてもよいフェニルC₁-C₆アルコキシ、Yで置換されてもよいフェニルC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシ、シアノC₁-C₆アルコキシ、ニトロC₁-C₆アルコキシ、（テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル）オキシ又は（テトラヒドロフラン-2-イル）オキシであり；R⁵は水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₁-C₆アルキルで置換されてもよいC₃-C₆シクロアルキル、ハロC₁-C₆アルキル、ハロC₃-C₆シクロアルキル、C₃-C₆シクロアルキルC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよいフェニル、Yで置換されてもよいフェニルC₁-C₆アルキル、ヒドロキシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルカルボニルオキシ、水酸基、C₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルチオ、ハロC₁-C₆アルキルチオ、C₁-C₆アルキ

ルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル又はハロ C_1-C_6 アルキルスルホニルであり； m が2の場合、複数の R^3 はおのこの同一でも相異なってもよく； R^5 はピペリジン環上に n 個置換してもよく、 n が2以上の場合、複数の R^5 はおのこの同一でも相異なってもよく、また同一の炭素上に置換してもよく； R^4 又は R^5 は、それらが結合する炭素原子と同一の炭素原子上の R^5 と結合し、オレフィン又はカルボニルを形成することができ； R^4 又は R^5 は、それらが結合する炭素原子と隣り合った炭素原子上の任意の R^4 又は R^5 と結合し二重結合を形成することができ；ただし、 Q が一般式（Q-1）で表されるチオフェン環のとき、 R^4 又は R^5 のうち少なくとも1つは、水素原子、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、 C_1-C_6 アルキルで置換されてもよい C_3-C_6 シクロアルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロ C_3-C_6 シクロアルキル、 C_3-C_6 シクロアルキル C_1-C_6 アルキル、 Y で置換されてもよいフェニル、 Y で置換されてもよいフェニル C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルカルボニルオキシ又は水酸基以外の置換基であり； Y はハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、 C_1-C_6 アルキルで置換されてもよい C_3-C_6 シクロアルキル、ハロ C_1-C_6 アルキル、ハロ C_2-C_6 アルケニル、ハロ C_2-C_6 アルキニル、ハロ C_3-C_6 シクロアルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル、カルボキシル、 C_1-C_6 アルキルカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル、ハロ C_1-C_6 アルコキシカルボニル、アミノ、モノ（ C_1-C_6 アルキル）アミノ、モノ（ハロ C_1-C_6 アルキル）アミノ、ジ（ C_1-C_6 アルキル）アミノ、ジ（ハロ C_1-C_6 アルキル）アミノ、シアノ、ニトロ又は水酸基であり；前記複素環は、チエニル、フリル、ピロリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、イソオキサゾリニル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、1,2,3-トリアゾリル

、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,3,4-テトラゾリル、ピリジル、ピリミジル、ピラジニル、ピリダジニル、1,3,5-トリアジニル、1,2,4-トリアジニル、ベンゾチエニル、ベンゾフリル、インドリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイソチアゾリル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、キノリル、イソキノリル、キノキサリニル、フタラジニル、シンノリニル、キナゾリニル、イミダゾリニル、イミダゾリジニル、ピラゾリニル又はピラゾリジニルである]

で表されるヘテロアリールスルホンアミド系化合物又はその塩に関する。

[0011] また、本発明は、前記一般式 (I) のヘテロアリールスルホンアミド系化合物又はその塩を有効成分として含有する除草剤、当該化合物又はその塩の除草有効量を、望ましくない植物又はそれが生育する場所に施用し、望ましくない植物を防除又はその生育を抑制する方法に関する。

発明の効果

[0012] 一般式 (I) のヘテロアリールスルホンアミド系化合物又はその塩は、類似する従来化合物に比して望ましくない植物（雑草）への著しい除草活性の向上を実現する。また、作物への高い安全性を有する。

発明を実施するための形態

[0013] 一般式 (I) 中のハロゲン原子又は置換基としてのハロゲンとしては、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素の各原子が挙げられる。置換基としてのハロゲン原子の数は1又は2以上であってよく、2以上の場合、各ハロゲン原子はおのの同一でも相異なってもよい。また、ハロゲン原子の置換位置は何れの位置でもよい。

[0014] 一般式 (I) 中のアルキル又はアルキル部分としては、例えば、メチル、エチル、ノルマルプロピル、イソプロピル、ノルマルブチル、イソブチル、セカンダリーブチル、ターシャリーブチル、ノルマルペンチル、ネオペンチル、ノルマルヘキシルのような直鎖又は分岐鎖状の C_1 - C_{12} の基が挙げられる。また、置換基の位置によっては、 C_1 - C_6 の基であってもよい。

[0015] 一般式 (I) 中のアルコキシ又はアルコキシ部分としては、例えば、メトキ

シ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ドデシルオキシなどのような直鎖又は分岐鎖状の C_1 - C_{12} の基が挙げられる。また、置換基の位置によっては、 C_1 - C_6 の基であってもよい。

[0016] 一般式 (I) 中のアルケニル又はアルケニル部分としては、例えば、ビニル、1-プロペニル、2-プロペニル、イソプロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-ヘキセニル、2,3-ジメチル-2-ブテニルのような直鎖又は分岐鎖状の C_2 - C_6 の基が挙げられる。また、置換基の位置によっては、上記アルケニル又はアルケニル部分は、直鎖又は分岐鎖状の C_3 - C_6 の基であってもよい。

[0017] 一般式 (I) 中のアルキニル又はアルキニル部分としては、例えば、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、2-メチル-3-ブチニル、1-ヘキシニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニルのような直鎖又は分岐鎖状の C_2 - C_6 の基が挙げられる。また、置換基の位置によっては、上記アルキニル又はアルキニル部分は、直鎖又は分岐鎖状の C_3 - C_6 の基であってもよい。

[0018] 一般式 (I) 中のシクロアルキル又はシクロアルキル部分としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルのような C_3 - C_6 の基が挙げられる。

[0019] 一般式 (I) 中のシクロアルコキシ部分としては、(シクロアルキル) -O-基を示し、例えば、シクロプロピルオキシ、シクロブチルオキシ、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシのような C_3 - C_6 の基が挙げられる。

[0020] 一般式 (I) 中の「 C_1 - C_6 アルキルカルボニル」又は「 C_1 - C_6 アルキルカルボニル部分」は、前記の C_1 - C_6 アルキル基とカルボニル基とが結合した (C_1 - C_6 アルキル) -C(=O)-基を示し、例えば、アセチル、プロピオニル、イソプロピオニル、ブチリル、ピバロイルなどのような直鎖又は分岐鎖状で炭素数が2から7の脂肪族カルボン酸から誘導されるアルキルカルボニル基が挙げ

られる。

[0021] 一般式 (I) 中、 R^2 に含まれる「 C_1 - C_{12} アルキルカルボニル」は、前記の C_1 - C_{12} アルキル基とカルボニル基とが結合した (C_1 - C_{12} アルキル) - C (=O) - 基を示し、例えば、アセチル、プロピオニル、イソプロピオニル、ブチリル、ピバロイル、デカノイル、ドデカノイルなどのような直鎖又は分岐鎖状で炭素数が2から13の脂肪族カルボン酸から誘導されるアルキルカルボニル基が挙げられる。

[0022] 一般式 (I) 中の「 C_2 - C_6 アルケニルカルボニル」又は「 C_2 - C_6 アルケニルカルボニル部分」は、前記の C_2 - C_6 アルケニル基とカルボニル基とが結合した (C_2 - C_6 アルケニル) - C (=O) - 基を示し、例えば、アクリロイル、クロトノイル、メタクリロイル、2-メチル-2-ブテノイルなどのような直鎖又は分岐鎖状で炭素数が3から7の不飽和脂肪族カルボン酸から誘導されるアルケニルカルボニル基が挙げられる。

[0023] 一般式 (I) 中の「シクロ C_3 - C_6 アルキルカルボニル」又は「 C_3 - C_6 シクロアルキルカルボニル部分」は、前記のシクロ C_3 - C_6 アルキル基とカルボニル基とが結合した (シクロ C_3 - C_6 アルキル) - C (=O) - 基を示し、例えば、シクロプロパンカルボニル、シクロブタンカルボニル、シクロペンタンカルボニル、シクロヘキサンカルボニルなどのような炭素数が4から7の環状脂肪族カルボン酸から誘導されるシクロアルキルカルボニル基が挙げられる。

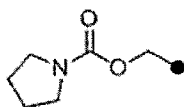
[0024] 一般式 (I) 中の「Yで置換されてもよい」とは、Yで置換される場合は、Yが1以上であってもよいことを表す。

[0025] 一般式 (I) 中の「 C_1 - C_6 アルキルで置換されてもよい」とは、 C_1 - C_6 アルキルで置換される場合は、 C_1 - C_6 アルキルが1以上であってもよいことを表す。

[0026] 一般式 (I) 中の「窒素原子上の2つの C_1 - C_6 アルキルが互いに結合して3~8員環を形成してもよいジ C_1 - C_6 アルキルアミノカルボニルオキシ C_1 - C_6 アルキル」とは、例えば、次のような構造が挙げられる。

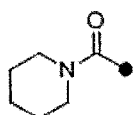
[0027]

[化3]



[0028] 一般式 (I) 中の「窒素原子上の2つのC₁-C₆アルキルが互いに結合して3~8員環を形成してもよいジC₁-C₆アルキルアミノカルボニル」とは、例えば、次のような構造が挙げられる。

[0029] [化4]



[0030] 一般式 (I) 中、R⁴又はR⁵は、それらが結合する炭素原子と同一の炭素原子上のR⁵と結合することができ、例えば、オレフィン又はカルボニルを形成することができる。

[0031] 一般式 (I) 中、R⁴又はR⁵は、それらが結合する炭素原子と隣り合った炭素原子上の任意のR⁴又はR⁵と結合することができ、例えば、二重結合を形成することができる。

[0032] そして、一般式 (I) のヘテロアリールスルホンアミド系化合物の塩としては、農業上許容されるものであればあらゆる塩が含まれるが、例えば、ナトリウム塩、カリウム塩のようなアルカリ金属塩；マグネシウム塩、カルシウム塩のようなアルカリ土類金属塩；ジメチルアミン塩、トリエチルアミン塩のようなアミン塩；塩酸塩、過塩素酸塩、硫酸塩、硝酸塩のような無機酸塩；酢酸塩、メタンスルホン酸塩のような有機酸塩などが挙げられる。

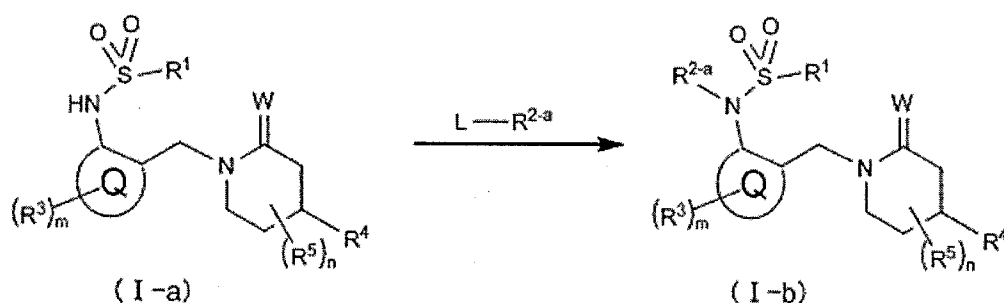
[0033] 一般式 (I) のヘテロアリールスルホンアミド系化合物には、ジアステレオ異性体や光学異性体のような異性体が存在する場合があるが、本発明には各異性体及び異性体混合物の双方が含まれる。本明細書においては、特に言及しない限り、異性体は混合物として記載する。尚、本発明には、当該技術分野における技術常識の範囲内において、前記異性体以外の各種異性体も含まれる。また、異性体の種類によっては、前記一般式 (I) とは異なる化学構造

となる場合があるが、当業者であればそれら化学構造が一般式 (I) と異性体の関係にあることが十分認識できるため、本発明の範囲内であることは明らかである。

[0034] 一般式 (I) のヘテロアリールスルホンアミド系化合物又はその塩（以下、本発明化合物と略す）は、以下の製造方法、並びに通常の前記化合物の製造方法、後述する合成例に従って製造することができるが、本発明化合物を得る方法は、これらの方法に限定されるものではない。

[0035] ・製造方法〔1〕

[0036] [化5]



[0037] (式中、Q、W、m、n、R¹、R³、R⁴及びR⁵は前述の通りであり、R^{2-a}はC₁-C₁₂アルコキシカルボニル、C₁-C₁₂アルキルカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルカルボニル、シクロC₃-C₆アルキルカルボニル、シクロC₃-C₆アルキルC₁-C₆アルキルカルボニル、C₂-C₆アルケニルカルボニル、Yで置換されてもよいフェニルC₂-C₆アルケニルカルボニル、Yで置換されてもよいフェニルカルボニル、Yで置換されてもよい複素環カルボニル、ハロC₁-C₁₂アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルで置換されてもよいシクロC₃-C₆アルコキシカルボニル、C₂-C₆アルケニルオキシカルボニル、ハロC₂-C₆アルケニルオキシカルボニル、C₂-C₆アルキニルオキシカルボニル、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₆アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₆アルコキシカルボニル、Yで置換されてもよいフェニルC₁-C₆アルコキシカルボニル、Yで置換されてもよいフェニルハロC₁-C₆アルコキシカルボニル、Yで置換されてもよいフェノキシカルボニル、Yで置換されてもよいフェノキシC₁-C₆アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルチオカ

ルボニル、ハロC₁-C₆アルキルチオカルボニル、モノC₁-C₆アルキルアミノカルボニル、モノ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノカルボニル、窒素原子上の2つのC₁-C₆アルキルが互いに結合して3～8員環を形成してもよいジC₁-C₆アルキルアミノカルボニル、ジ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノカルボニル、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルコシオキサリル、C₁-C₆アルキルスルホニル、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル、Yで置換されてもよいフェニルスルホニル、Yで置換されてもよい複素環スルホニル、シクロC₃-C₆アルキルスルホニル、C₁-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよいフェニルC₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₁-C₆アルキルカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、シクロC₃-C₆アルキルカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよいフェニルカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよい複素環カルボニルオキシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、シクロC₃-C₆アルコキシカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよいフェノキシカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、モノC₁-C₆アルキルアミノカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、窒素原子上の2つのC₁-C₆アルキルが互いに結合して3～8員環を形成してもよいジC₁-C₆アルキルアミノカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよいフェニルアミノカルボニルオキシC₁-C₆アルキル又はYで置換されてもよいN-C₁-C₆アルキル-N-フェニルアミノカルボニルオキシC₁-C₆アルキルであり、Lはハロゲン原子、C₁-C₆アルキルスルホニルオキシ、Yで置換されてもよいフェニルスルホニルオキシなどの脱離基を示す。）

一般式（I-b）で表される化合物は、一般式（I-a）で表される化合物とR²-aLとを反応させて製造することができる。

[0038] 上記反応は、必要に応じて溶媒の存在下に行うことができる。溶媒としては、反応に不活性であれば特に制限はなく、例えば、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、トリクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、ニトロベンゼン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル

のようなエステル類；アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド（DMF）、ジメチルスルホキシド（DMSO）、ジメチルアセトアミド（DMA）、ヘキサメチルリン酸トリアミド（HMPA）、スルホランのような非プロトン性極性溶媒；ジエチルエーテル、ターシャリーブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン（THF）、1,2-ジメトキシエタンのようなエーテル類；メタノール、エタノール、イソプロパノールのようなアルコール類；水；などが挙げられる。溶媒としては、これらの1種又は2種以上を適宜選択することができる。

[0039] 上記反応は、必要に応じて塩基の存在下に行うことができる。塩基としては、有機塩基及び無機塩基の何れでもよい。有機塩基としては、例えば、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンのような第三級アミン類；1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン（DBU）；ピリジン；4-（ジメチルアミノ）ピリジン；2,6-ルチジン；などが挙げられる。無機塩基としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムのようなアルカリ金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属炭酸水素塩；炭酸カルシウム、炭酸バリウムのようなアルカリ土類金属炭酸塩；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物；水酸化カルシウム、水酸化バリウムのようなアルカリ土類金属水酸化物；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムターシャリーブトキシドなどのアルカリ金属アルコキシド類；ナトリウムヒドリド、カリウムヒドリドなどのアルカリ金属ヒドリド類；ブチルリチウムなどのアルカリ金属アルキル類；酢酸ナトリウム、酢酸カリウムなどのアルカリ金属カルボン酸塩；などが挙げられる。塩基としては、これらの1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

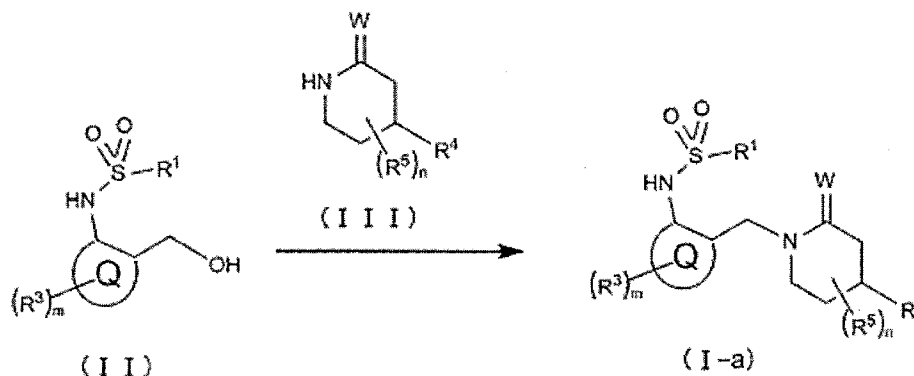
[0040] 上記反応は、必要に応じて相間移動触媒の存在下に行うことができる。相間移動触媒としては、例えば、テトラノルマルブチルアンモニウムブロミド、ベンジルトリエチルアンモニウムブロミドのような四級アンモニウム塩；18-クラウン6-エーテル；などが挙げられる。また、上記反応はトリメチルア

ミン塩酸塩やヨウ化カリウムなどの添加物の存在下に行うことができる。

[0041] 上記反応の反応温度は、通常、0℃から使用する溶媒の沸点までの範囲内、反応時間は、通常1分間～48時間の範囲内で行うことができる。

[0042] ・製造方法〔2〕

[0043] [化6]



[0044] (式中、Q、W、m、n、R¹、R³、R⁴及びR⁵は前述の通りである。)

一般式 (I-a) で表される化合物は、後述の方法で合成できる中間体 (II) と、市販されている、或いは公知の方法に準じて合成できる中間体 (III) との反応により製造することができる。

[0045] 上記反応は、必要に応じて溶媒の存在下に行うことができる。溶媒としては、反応に不活性であれば特に制限はなく、例えば、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、トリクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、ニトロベンゼン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；ノルマルヘキサン、ノルマルヘプタンのような炭化水素類；酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピルのようなエステル類；アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド (DMF)、ジメチルスルホキシド (DMSO)、ジメチルアセトアミド (DMA)、ヘキサメチルリン酸トリアミド (HMPA)、スルホランのような非プロトン性極性溶媒；ジエチルエーテル、ターシャリーブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン (THF)、1,2-ジメトキシエタンのようなエーテル類；などが挙げられる。溶媒としては、これらの1種又は2種以上を適宜選択することができる。

[0046] 上記反応は、必要に応じて相間移動触媒の存在下に行うことができる。相

間移動触媒としては、製造方法〔1〕と同様のものなどが挙げられる。

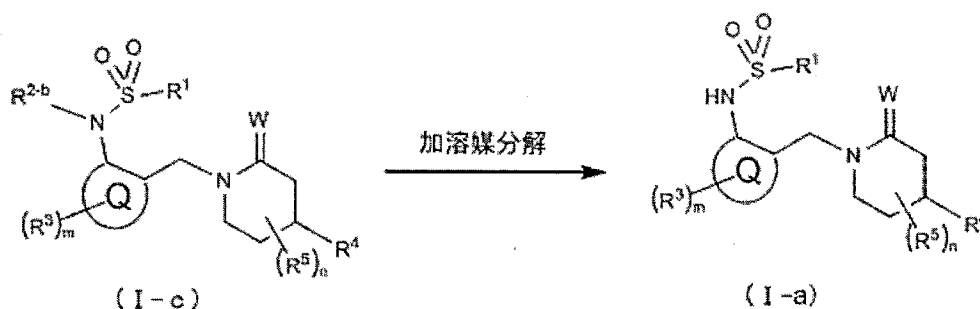
[0047] 上記反応は、必要に応じて塩基の存在下に行うことができる。塩基としては、有機塩基及び無機塩基の何れでもよく、製造方法〔1〕と同様のものなどが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

[0048] 上記反応は、必要に応じて酸触媒の存在下に行うことができる。酸触媒としては、例えば、ギ酸、酢酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸、トリフルオロ酢酸、トリフルオロメタンスルホン酸のような有機酸；塩酸、硫酸、臭化水素酸のような無機酸類；塩化亜鉛、四塩化チタン、塩化すず、塩化アルミニウム、塩化鉄、三フッ化ホウ素-エーテル錯体のようなルイス酸類；などが挙げられる。

[0049] 上記反応の反応温度は、通常、0℃～150℃の範囲内、望ましくは室温から使用する溶媒の沸点までの範囲内、反応時間は、通常、1分間～72時間の範囲内で行うことができる。

[0050] ・製造方法〔3〕

[0051] [化7]



[0052] (式中、Q、W、m、n、R¹、R³、R⁴及びR⁵は前述の通りである。R^{2-b}はC₁-C₁₂アルコキシカルボニル、C₁-C₁₂アルキルカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルカルボニル、シクロC₃-C₆アルキルカルボニル、シクロC₃-C₆アルキルC₁-C₆アルキルカルボニル、C₂-C₆アルケニルカルボニル、Yで置換されてもよいフェニルC₂-C₆アルケニルカルボニル、Yで置換されてもよいフェニルカルボニル、Yで置換されてもよい複素環カルボニル、ハロC₁-C₁₂アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルで置換されてもよいシクロC₃-C₆アルコキシカルボニル、C₂-C₆アルケニルオキシカル

ルボニル、ハロC₂-C₆アルケニルオキシカルボニル、C₂-C₆アルキニルオキシカルボニル、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₆アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₆アルコキシカルボニル、Yで置換されてもよいフェニルC₁-C₆アルコキシカルボニル、Yで置換されてもよいフェニルハロC₁-C₆アルコキシカルボニル、Yで置換されてもよいフェノキシカルボニル、Yで置換されてもよいフェノキシC₁-C₆アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルチオカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルチオカルボニル、モノC₁-C₆アルキルアミノカルボニル、モノ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノカルボニル、窒素原子上の2つのC₁-C₆アルキルが互いに結合して3～8員環を形成してもよいジC₁-C₆アルキルアミノカルボニル、ジ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノカルボニル、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルコシオキサリル、C₁-C₆アルキルスルホニル、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル、Yで置換されてもよいフェニルスルホニル、Yで置換されてもよい複素環スルホニル又はシクロC₃-C₆アルキルスルホニルである。）

一般式（I-a）で表される化合物は、一般式（I-c）で表される化合物のR^{2-b}基を、塩基などを用いて除去することで製造することができる。

[0053] 塩基としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムのようなアルカリ金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属炭酸水素塩；炭酸カルシウム、炭酸バリウムのようなアルカリ土類金属炭酸塩；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物；水酸化カルシウム、水酸化バリウムのようなアルカリ土類金属水酸化物；などが挙げられる。塩基としては、これらの1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

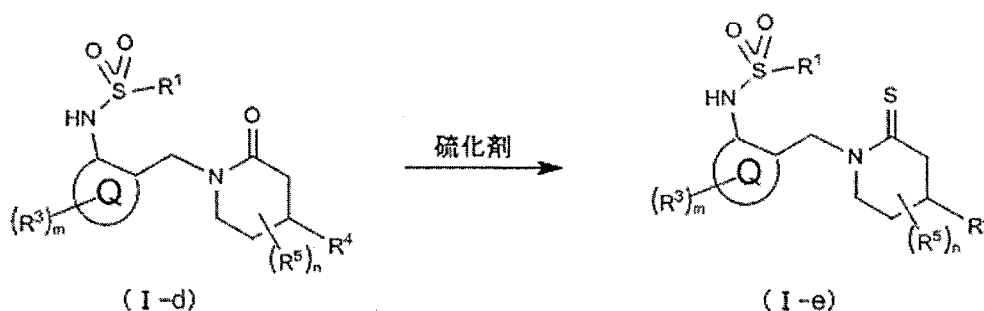
[0054] また、上記反応は溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性であれば特に制限はなく、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノールのようなアルコール類；アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド（DMF）、ジメチルスルホキシド（DMSO）、ジメチルアセトアミド（DM

A)、ヘキサメチルリン酸トリアミド (HMPA)、スルホランのような非プロトン性極性溶媒；ジエチルエーテル、ターシャリーブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン (THF)、1,2-ジメトキシエタンのようなエーテル類；水；などが挙げられる。溶媒としては、これらの1種又は2種以上を適宜選択することができる。

[0055] 上記反応の反応温度は、通常、0℃～100℃の範囲内、反応時間は、通常、1分間～72時間の範囲内で行うことができる。

[0056] ・製造方法〔4〕

[0057] [化8]



[0058] (式中、Q、m、n、 R^1 、 R^3 、 R^4 及び R^5 は前述の通りである。)

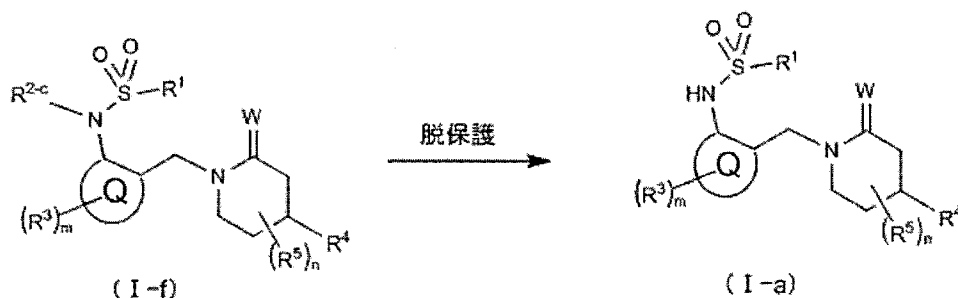
上記反応で使用する硫化剤としては、例えば、 P_4S_{10} やローソン試薬などが挙げられる。

[0059] また、上記反応は溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性であれば特に制限はなく、例えば、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、トリクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、ニトロベンゼン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；ノルマルヘキサン、ノルマルヘプタンのような炭化水素類；ジエチルエーテル、ターシャリーブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン (THF)、1,2-ジメトキシエタンのようなエーテル類；などが挙げられる。溶媒としては、これらの1種又は2種以上を適宜選択することができる。

[0060] 上記反応の反応温度は、通常、0℃～150℃の範囲内、反応時間は、通常、1分間～72時間の範囲内で行うことができる。

[0061] ・製造方法〔5〕

[0062] [化9]



[0063] (式中、Q、W、m、n、R¹、R³、R⁴及びR⁵は前述の通りであり、R^{2-c}はパラメトキシベンジル (PMB) 基、2,4-ジメトキシベンジル基などの保護基である。)

上記反応は、トリフルオロ酢酸 (TFA) を用いて行うことができ、トリエチルシランなどを加えてもよい。

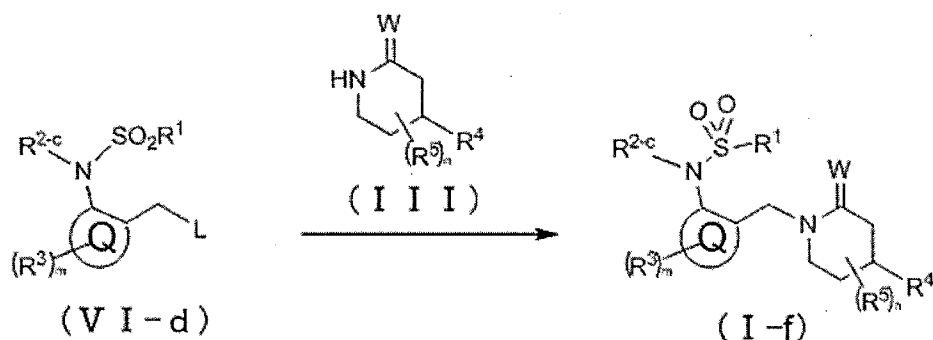
[0064] また、上記反応は、必要に応じて溶媒の存在下に行うことができる。溶媒としては、反応に不活性であれば特に制限はなく、例えば、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、トリクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、ニトロベンゼン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピルのようなエステル類；アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド (DMF)、ジメチルスルホキシド (DMSO)、N,N-ジメチルアセトアミド (DMA)、ヘキサメチルリン酸トリアミド (HMPA)、スルホランのような非プロトン性極性溶媒；ジエチルエーテル、ターシャリーブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン (THF)、1,2-ジメトキシエタンのようなエーテル類；などが挙げられる。溶媒としては、これらの1種又は2種以上を適宜選択することができる。

[0065] 上記反応の反応温度は、通常、0℃～150℃の範囲内、反応時間は、通常、1分間～200時間の範囲内で行うことができる。

[0066] ・製造方法〔6〕

[0067]

[化10]



[0068] (式中、Q、W、m、n、R¹、R^{2-c}、R³、R⁴、R⁵及びLは前述の通りである。)

一般式 (I-f) で表される化合物は、後述の方法で合成できる中間体 (VI-d) と、市販されている、或いは公知の方法に準じて合成できる中間体 (III) との反応により製造することができる。

[0069] 上記反応は、必要に応じて溶媒の存在下に行うことができる。溶媒としては、反応に不活性であれば特に制限はなく、例えば、前記製造方法〔5〕と同様のものなどが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択することができる。

[0070] 上記反応は、必要に応じて塩基の存在下に行うことができる。塩基としては、有機塩基及び無機塩基の何れでもよく、前記製造方法〔1〕と同様のものなどが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

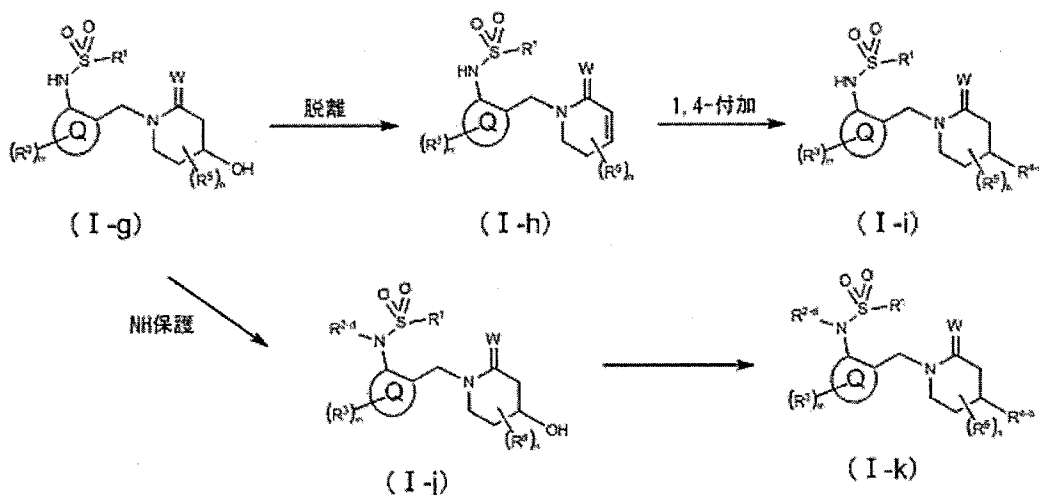
[0071] 上記反応は、必要に応じて相間移動触媒の存在下に行うことができる。相間移動触媒としては、例えば、テトラノルマルブチルアンモニウムブロミド、ベンジルトリエチルアンモニウムブロミドのような四級アンモニウム塩；18-クラウン6-エーテル；などが挙げられる。また、上記反応はヨウ化カリウムなどの添加物の存在下に行うことができる。

[0072] 上記反応の反応温度は、通常、0℃から使用する溶媒の沸点までの範囲内、反応時間は、通常、1分間～48時間の範囲内で行うことができる。

[0073] ・製造方法〔7〕

[0074]

[化11]



[0075] (式中、Q、W、m、n、R¹、R³及びR⁵は前述の通りであり、R^{2-d}はC₁-C₁₂アルコキシカルボニル、ハロC₁-C₁₂アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルで置換されてもよいシクロC₃-C₆アルコキシカルボニル、C₂-C₆アルケニルオキシカルボニル、ハロC₂-C₆アルケニルオキシカルボニル、C₂-C₆アルキニルオキシカルボニル、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₆アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₆アルコキシカルボニル、Yで置換されてもよいフェニルC₁-C₆アルコキシカルボニル、Yで置換されてもよいフェニルハロC₁-C₆アルコキシカルボニル、Yで置換されてもよいフェノキシカルボニル、Yで置換されてもよいフェノキシC₁-C₆アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルチオカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルチオカルボニルなどの保護基である。またR^{4-a}はC₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルコキシ、C₃-C₆アルケニルオキシ、C₃-C₆アルキニルオキシ、C₁-C₆アルキルチオ、ハロC₁-C₆アルキルチオ、Yで置換されてもよいフェノキシ、Yで置換されてもよいフェニルチオ、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₆アルコキシ、ヒドロキシC₁-C₆アルコキシ、モノ(C₁-C₆アルキル)アミノC₁-C₆アルコキシ、窒素原子上の2つのC₁-C₆アルキルが互いに結合して3

～8員環を形成してもよいジ (C_1-C_6 アルキル) アミノ C_1-C_6 アルコキシ、Yで置換されてもよいフェノキシ C_1-C_6 アルコキシ、Yで置換されてもよいフェニル C_1-C_6 アルコキシ、Yで置換されてもよいフェニル C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルコキシ、シアノ C_1-C_6 アルコキシ又はニトロ C_1-C_6 アルコキシであり、 R^{4-b} は C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルコキシ、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルコキシ、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルコキシ、モノ (C_1-C_6 アルキル) アミノ C_1-C_6 アルコキシ、窒素原子上の2つの C_1-C_6 アルキルが互いに結合して3～8員環を形成してもよいジ (C_1-C_6 アルキル) アミノ C_1-C_6 アルコキシ、Yで置換されてもよいフェノキシ C_1-C_6 アルコキシ、Yで置換されてもよいフェニル C_1-C_6 アルコキシ、Yで置換されてもよいフェニル C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルコキシ、シアノ C_1-C_6 アルコキシ、ニトロ C_1-C_6 アルコキシ、(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル) オキシ又は(テトラヒドロフラン-2-イル) オキシである。)

一般式 (I-i) 又は (I-k) で表される化合物は、上述の製造方法に準じて合成できる化合物 (I-g) より製造することができる。一般式 (I-i) 又は (I-k) で表される化合物の製造方法を以下に詳述する。

[0076] ・製造方法〔7-1〕

一般式 (I-g) → 一般式 (I-h)

上記反応は、水酸基の脱離反応であり、例えばメタンサルホニル化又はパラトルエンスルホニル化の後に塩基を作用させることで達成できる。

[0077] 溶媒としては、反応に不活性であれば特に制限はなく、例えば、前記製造方法〔5〕と同様のものなどが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択することができる。

[0078] 上記反応で用いる塩基としては、有機塩基及び無機塩基の何れでもよい。有機塩基としては、例えば、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンのような第三級アミン類；1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン (DBU

）；ピリジン；4-（ジメチルアミノ）ピリジン；2,6-ルチジンなどが挙げられる。無機塩基としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムのようなアルカリ金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属炭酸水素塩；炭酸カルシウム、炭酸バリウムのようなアルカリ土類金属炭酸塩；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムターシャリーブトキシドなどのアルカリ金属アルコキシド類；などが挙げられる。塩基としては、これらの1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

[0079] 上記反応の反応温度は、通常、0℃から使用する溶媒の沸点までの範囲内、反応時間は、通常、1分間～48時間の範囲内で行うことができる。

[0080] ・製造方法〔7-2〕

一般式 (I-h) → 一般式 (I-i)

上記反応は、R^{4-a}部位に対応するアルコール、チオール、フェノール又はチオフエノールを塩基と共に α 、 β -不飽和カルボニル化合物 (I-h) に作用させることで達成できる。

[0081] 上記反応は、必要に応じて溶媒を用いてもよく、例えば、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、トリクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、ニトロベンゼン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド (DMF)、ジメチルスルホキシド (DMSO)、ジメチルアセトアミド (DMA)、ヘキサメチルリン酸トリアミド (HMPA)、スルホランのような非プロトン性極性溶媒；ジエチルエーテル、ターシャリーブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン (THF)、1,2-ジメトキシエタンのようなエーテル類；ターシャリーブタノール、イソプロパノールのようなアルコール類；水；などが挙げられる。溶媒としては、これらの1種又は2種以上を適宜選択することができる。

[0082] 上記反応で用いる塩基としては、有機塩基及び無機塩基の何れでもよい。有機塩基としては、例えば、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン (DBU

）；フォスファゼン塩基などが挙げられる。無機塩基としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムのようなアルカリ金属炭酸塩；炭酸カルシウム、炭酸バリウムのようなアルカリ土類金属炭酸塩；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムターシャリーブトキシドなどのアルカリ金属アルコキシド類；ナトリウムヒドリド、カリウムヒドリドなどのアルカリ金属ヒドリド類；などが挙げられる。塩基としては、これらの1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

[0083] 上記反応の反応温度は、通常、0℃から使用する溶媒の沸点までの範囲内、反応時間は、通常、1分間～48時間の範囲内で行うことができる。

[0084] ・製造方法〔7-3〕

一般式 (I-g) → 一般式 (I-j)

上記反応は、スルホンアミドのR^{2-d}による保護であり、前記製造方法〔1〕と同様の条件で行うことができる。

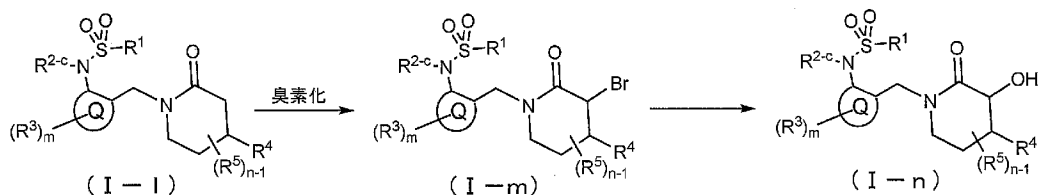
[0085] ・製造方法〔7-4〕

一般式 (I-j) → 一般式 (I-k)

上記反応は、水酸基の保護（例えばテトラヒドロピラニル（THP）基やメトキシメチル（MOM）基）に用いられる条件、例えば、GREEN'S PROTECTIVE GROUPS in Organic Synthesis; 4th Edition (John Wiley and Sons, 2007年、Peter G. M. Wuts, Theodora W. Greene) に記載の方法により行うことができる。

[0086] ・製造方法〔8〕

[0087] [化12]



[0088] (式中、Q、m、n、R¹、R^{2-c}、R³、R⁴及びR⁵は前述の通りである。)

一般式 (I-n) で表される化合物は、特許文献4に記載の方法に準じて臭素

化した一般式 (I-m) で表される化合物を経由して合成することができる。製造方法を以下に詳述する。

[0089] ・製造方法〔8-1〕

一般式 (I-l) → 一般式 (I-m)

上記反応は、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類中で、トリエチルアミンのような第三級アミン類とトリフルオロメタンスルホン酸トリメチルシリルを反応させた後、トリメチルフェニルアンモニウムトリブロミドのような臭素化剤を作用させることで達成することができる。

[0090] 上記反応の反応温度は、通常、 -20°C ～室温の範囲内、反応時間は、通常、1分間～48時間の範囲内で行うことができる。

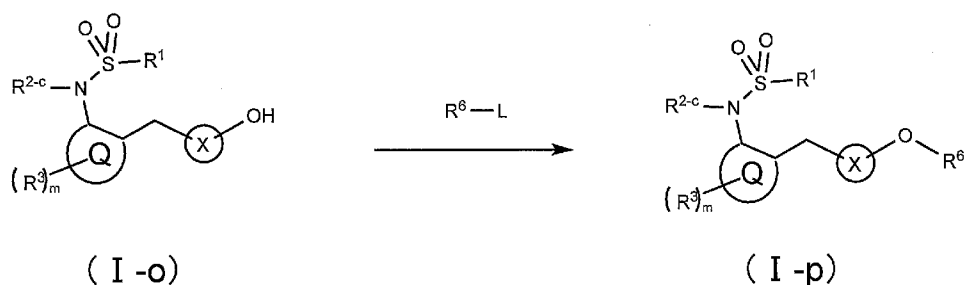
[0091] ・製造方法〔8-2〕

一般式 (I-m) → 一般式 (I-n)

上記反応は、Tetrahedron Asymmetry, 14, 2587-2594(2003)等に記載の方法に準じて行えばよい。

[0092] ・製造方法〔9〕

[0093] [化13]



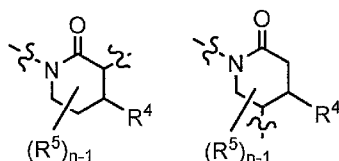
[0094] (式中、Q、m、L、 R^1 、 R^{2-c} 及び R^3 は前述の通りであり、 R^6 は C_1 - C_6 アルキル、ハロ C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_6 アルケニル、 C_3 - C_6 アルキニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル等であり、X:

[0095] [化14]



[0096] は、

[0097] [化15]



[0098] (式中、 n 、 R^4 及び R^5 は前述の通りである) 等を表す。)

一般式 (I-p) で表される化合物は、前述の製造方法により合成できる一般式 (I-o) で表される化合物の水酸基を、例えばアルキル化することにより製造することができる。

[0099] 上記反応で用いる溶媒は、例えば、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、トリクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、ニトロベンゼン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；アセトニトリル、 N,N -ジメチルホルムアミド (DMF)、ジメチルスルホキシド (DMSO)、ジメチルアセトアミド (DMA)、ヘキサメチルリン酸トリアミド (HMPA)、スルホランのような非プロトン性極性溶媒；ジエチルエーテル、ターシャリーブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン (THF)、1,2-ジメトキシエタンのようなエーテル類；などが挙げられる。溶媒としては、これらの1種又は2種以上を適宜選択することができる。

[0100] 上記反応で用いる塩基としては、有機塩基及び無機塩基の何れでもよく、前記製造方法〔1〕と同様のものなどが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

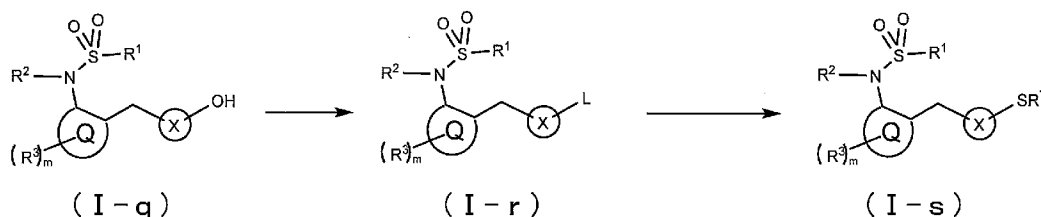
[0101] 上記反応は、必要に応じて相間移動触媒の存在下に行うことができる。相間移動触媒としては、例えば、テトラノルマルブチルアンモニウムブロミド、ベンジルトリエチルアンモニウムブロミドのような四級アンモニウム塩；18-クラウン6-エーテル；などが挙げられる。また、上記反応はヨウ化カリウムなどの添加物の存在下に行うことができる。

[0102] 上記反応の反応温度は、通常、 0°C から使用する溶媒の沸点までの範囲内

、反応時間は、通常、1分間～48時間の範囲内で行うことができる。

[0103] ・製造方法〔10〕

[0104] [化16]



[0105] (式中、Q、m、 R^1 、 R^2 、 R^3 、X及びLは前述の通りであり、 R^7 は C_1 - C_6 アルキル又はハロ C_1 - C_6 アルキルである。)

一般式 (I-s) で表される化合物は、前述の製造方法により合成できる一般式 (I-q) で表される化合物の水酸基を脱離基に変換することにより製造できる一般式 (I-r) で表される化合物に、チオールやその金属塩を作用させることで製造することができる。製造方法を以下に詳述する。

[0106] ・製造方法〔10-1〕

一般式 (I-q) → 一般式 (I-r)

上記反応は、水酸基をハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキルスルホニルオキシ、Yで置換されてもよいフェニルスルホニルオキシなどの脱離基へと変換する反応であり、例えばメタンスルホニル化又はパラトルエンスルホニル化は、Tetrahedron Lett., 44, 7981-7984(2003)、Bull. Chem. Soc. Jpn., 65, 3064-3067(1992)、W02011/146335、US4772597等に記載の方法に準じて行えばよい。

[0107] ・製造方法〔10-2〕

一般式 (I-r) → 一般式 (I-s)

上記反応は、対応するチオールと無機塩基により調整したチオラートや市販のチオール金属塩、例えばナトリウムチオメトキシドやナトリウムエタンチオラートを作用させることで達成することができる。

[0108] 用いる無機塩基としては、例えば、前記製造方法〔7〕と同様のものなどが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択することができる。

[0109] 上記反応で用いる溶媒としては、反応に不活性であれば特に制限はなく、

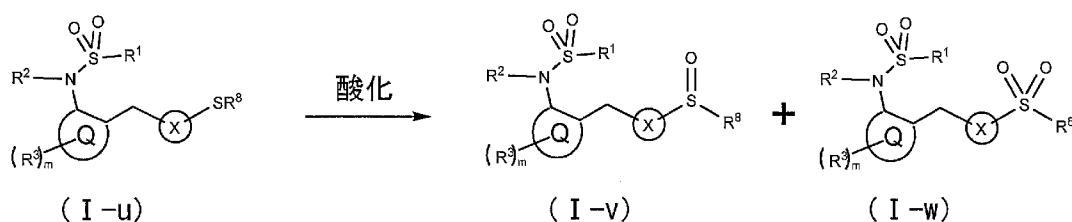
例えば、前記製造方法〔7〕と同様のものなどが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択することができる。

[0110] 上記反応は、必要に応じて相間移動触媒やヨウ化カリウムなどの添加物の存在下に行うことができる。相間移動触媒としては、前記製造方法〔9〕と同様のものなどが挙げられる。

[0111] 上記反応の反応温度は、通常、0℃から使用する溶媒の沸点までの範囲内、反応時間は、通常、1分間～48時間の範囲内で行うことができる。

[0112] ・製造方法〔11〕

[0113] [化17]



[0114] (式中、Q、m、R¹、R²、R³及びXは前述の通りであり、R⁸はC₁-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキル又はYで置換されてもよいフェニルである。)

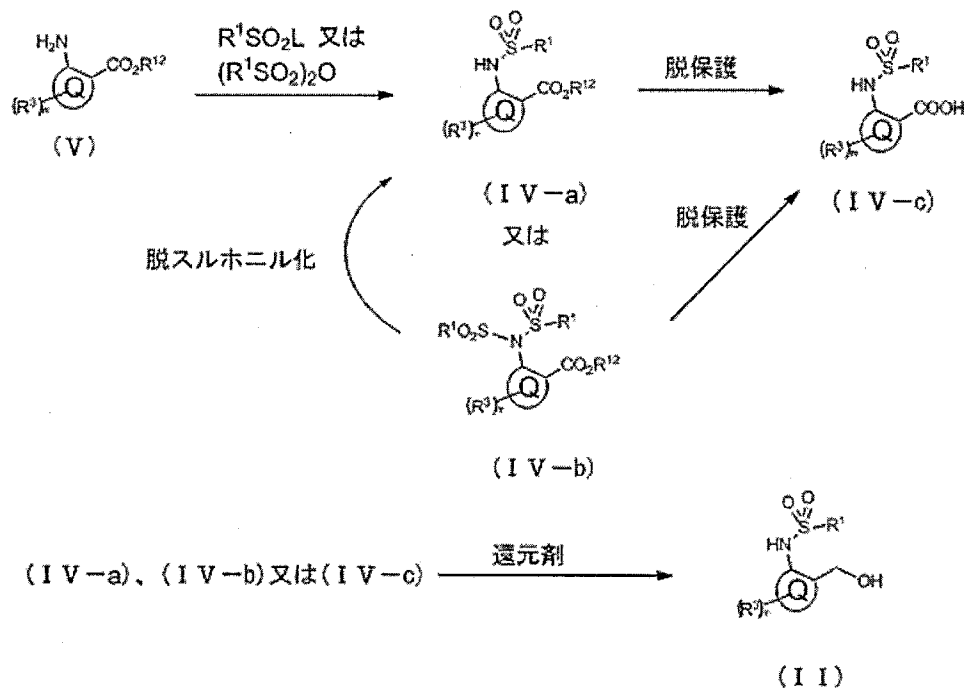
上記反応は硫黄の酸化反応であり、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類中で、メタクロロ過安息香酸等の酸化剤を作用させることにより達成することができる。例えば、J. Org. Chem., 57, 5741-5747(1992)、Org. Lett., 11, 4386-4389(2009)等に記載の方法に準じて行えばよい。

[0115] 本発明で用いる中間体の製造方法を以下に示す。

[0116] ・中間体製造方法〔1〕

[0117]

[化18]



[0118] (式中、m、R¹、R³及びLは前述の通りである。R¹²はC₁-C₆アルキルを示す。)

中間体製造方法〔1〕の各工程について、以下に詳述する。

[0119] ・中間体製造方法〔1-1〕

一般式 (V) → 一般式 (IV-a) 又は一般式 (IV-b)

上記反応は、市販されている、又は公知の方法に準じて合成できる中間体 (V) のスルホニル化反応であり、必要に応じて溶媒の存在下に行うことができる。溶媒としては、反応に不活性であれば特に制限はなく、例えば、前記製造方法〔2〕と同様のものなどが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択することができる。

[0120] 上記反応は、必要に応じて塩基の存在下に行うことができる。塩基としては、有機塩基及び無機塩基の何れでもよく、前記製造方法〔1〕と同様のものなどが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

[0121] 上記反応の反応温度は、通常、-70℃～150℃の範囲内、望ましくは、-20℃～50℃の範囲内、反応時間は、通常、1分間～72時間の範囲内で行うことができる。

[0122] 上記反応は、必要に応じて不活性ガスの存在下に行うことができる。当該不活性ガスとしては、例えば、アルゴンガス、窒素ガスなどが挙げられる。

[0123] ・中間体製造方法〔1-2〕

一般式 (IV-b) → 一般式 (IV-a)

上記反応は、必要に応じて溶媒の存在下に行うことができる。溶媒としては、反応に不活性であれば特に制限はなく、例えば、前記製造方法〔1〕と同様のものなどが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択することができる。

[0124] 上記反応は、必要に応じて塩基の存在下に行うことができる。塩基としては、有機塩基及び無機塩基の何れでもよい。有機塩基としては、アンモニア、ヒドロキシルアミンなどが挙げられる。無機塩基としては、前記製造方法〔1〕と同様のものなどが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

[0125] 上記反応は、必要に応じて相間移動触媒の存在下に行うことができる。相間移動触媒としては、前記製造方法〔1〕と同様のものなどが挙げられる。

[0126] 上記反応の反応温度は、通常、0℃から使用する溶媒の沸点までの範囲内、反応時間は、通常、1分間～72時間の範囲内で行うことができる。

[0127] ・中間体製造方法〔1-3〕

一般式 (IV-a) 又は一般式 (IV-b) → 一般式 (IV-c)

上記反応は、エステルからカルボン酸への脱保護反応であり、公知の方法に準じて行うことができる。例えば、塩基を用いることができ、無機塩基としては、前記製造方法〔1〕と同様のものなどが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択、混合して使用することができる。

[0128] 上記反応で用いる溶媒としては、反応に不活性であれば特に制限はなく、例えば、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド (DMF)、ジメチルスルホキシド (DMSO)、ジメチルアセトアミド (DMA)、ヘキサメチルリン酸トリアミド (HMPA)、スルホランのような非プロトン性極性溶媒；ジエチルエーテル、ターシャリーブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロ

フラン（THF）、1,2-ジメトキシエタンのようなエーテル類；メタノール、エタノール、イソプロパノールのようなアルコール類；水などが挙げられる。

溶媒としては、これらの1種又は2種以上を適宜選択することができる。

[0129] 上記反応の反応温度は、通常、0℃～100℃の範囲内、反応時間は、通常、1分間～72時間の範囲内で行うことができる。

[0130] ・中間体製造方法〔1-4〕

一般式（IV-a）、一般式（IV-b）又は一般式（IV-c）→ 一般式（II）

上記反応で使用する還元剤としては、例えば、水素化リチウムアルミニウム、水素化ジイソブチルアルミニウム、水素化ビス（2-メトキシエトキシ）アルミニウムナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、ボランTHF錯体などが挙げられる。

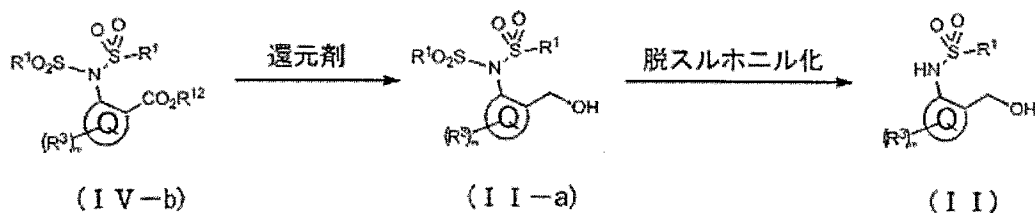
[0131] 上記反応で使用する溶媒としては、反応に不活性であれば特に制限はなく、例えば、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン、トリクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ターシャリーブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン（THF）、1,2-ジメトキシエタンのようなエーテル類；などが挙げられる。溶媒としては、これらの1種又は2種以上を適宜選択することができる。

[0132] 上記反応の反応温度は、通常、-70℃から使用する溶媒の沸点までの範囲内、反応時間は、通常、1分間～72時間の範囲内で行うことができる。

[0133] 上記反応は、必要に応じて不活性ガスの存在下に行うことができる。当該不活性ガスとしては、例えば、アルゴンガス、窒素ガスなどが挙げられる。

[0134] ・中間体製造方法〔2〕

[0135] [化19]

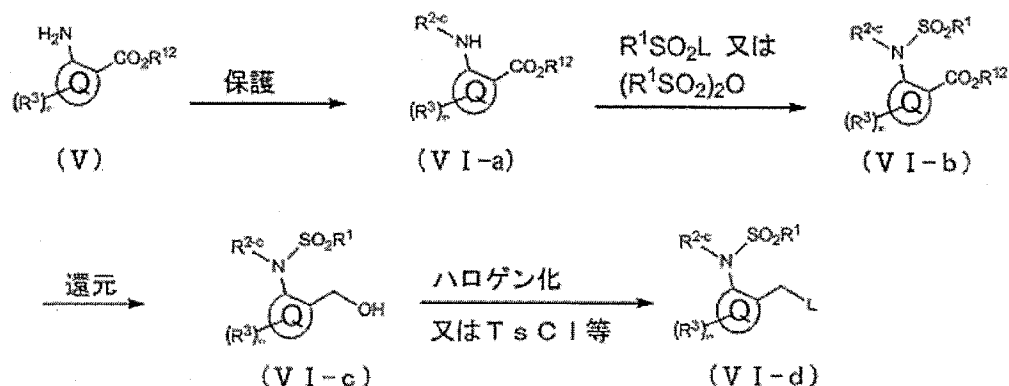


[0136] (式中、 m 、 R^1 、 R^3 及び R^{12} は前述の通りである。)

上記反応は、前記中間体製造方法〔1〕に準じて行うことができる。

[0137] ・中間体製造方法〔3〕

[0138] [化20]



[0139] (式中、 m 、 R^1 、 R^{2-c} 、 R^3 、 R^{12} 及び L は前述の通りである。)

中間体製造方法〔3〕の各工程について、以下に詳述する。

[0140] ・中間体製造方法〔3-1〕

一般式 (V) → 一般式 (VI-a)

上記反応は、一般式 (V) で表されるアミン化合物と、 R^{2-c} 部位に対応するアルデヒドとの還元的アミノ化により達成できる。当該反応は、例えば、J. Org. Chem., 61, 3849-3862(1996)に記載の方法に準じて行うことができる。

[0141] ・中間体製造方法〔3-2〕

一般式 (VI-a) → 一般式 (VI-b)

上記反応は、前記中間体製造方法〔1〕に準じて行うことができる。

[0142] ・中間体製造方法〔3-3〕

一般式 (VI-b) → 一般式 (VI-c)

上記反応は、前記中間体製造方法〔1〕に準じて行うことができる。

[0143] ・中間体製造方法〔3-4〕

一般式 (VI-c) → 一般式 (VI-d)

上記反応は、水酸基をハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキルスルホニルオキシ、 Y で置換されてもよいフェニルスルホニルオキシなどの脱離基へと変換する反応

である。

- [0144] ハロゲン化反応は、例えば、N-クロロスクシンイミド (NCS) -トリフェニルホスフィン (PPh₃)、四塩化炭素-PPh₃、四臭化炭素-PPh₃、ヨウ素-イミダゾール-PPh₃などの組み合わせにより行うことができる。また、スルホニル化反応は、メタンスルホニルクロリド、p-トルエンスルホニルクロリドなどの塩化スルホニルと、前記製造方法〔1〕に例示した有機塩基と共に行うことができる。
- [0145] 上記反応で使用する溶媒としては、反応に不活性であれば特に制限はなく、例えば、前記中間体製造方法〔1-4〕と同様のものなどが挙げられ、これらの1種又は2種以上を適宜選択することができる。
- [0146] 上記反応の反応温度は、通常、0℃から使用する溶媒の沸点までの範囲内、反応時間は、通常、1分間～72時間の範囲内で行うことができる。
- [0147] 尚、本発明化合物を製造するにあたって用いる中間体の製造方法は、上記例示の製造方法に限定されるものではなく、如何なる製造方法を採用してもよい。また、出発物質である中間体も、上記例示の中間体に限定されるものではなく、本発明化合物を製造することができる化合物であれば、如何なる化合物を中間体としてもよい。
- [0148] 本発明化合物は、除草剤の有効成分として使用した場合に、優れた除草効果を示す。その適用範囲は、水田、畑地、果樹園、桑園などの農耕地、山林、農道、グラウンド、工場敷地などの非農耕地と多岐にわたり、適用方法も土壌処理、茎葉処理、湛水処理などを適宜選択することができる。
- [0149] 本発明化合物は、一年生雑草や多年生雑草などの広範囲の望ましくない植物を防除することができる。具体的には、例えばイヌビエ又はタイヌビエ(*barnyardgrass* (*Echinochloa crus-galli* L., *Echinochloa oryzicola* vasing.)), メヒシバ(*crabgrass* (*Digitaria sanguinalis* L., *Digitaria ischaemum* Muhl., *Digitaria adscendens* Henr., *Digitaria microbachne* Henr., *Digitaria horizontalis* Willd.)), エノコログサ(*green foxtail* (*Setaria viridis* L.)), アキノエノコログサ(*giant foxtail* (*Setaria faberi* Herrm.))

、キンエノコロ(yellow foxtail (Setaria lutescens Hubb.)), オヒシバ(goosegrass (Eleusine indica L.)), カラスムギ(wild oat (Avena fatua L.))、セイバンモロコシ(johnsongrass (Sorghum halepense L.)), シバムギ(quackgrass (Agropyron repens L.)), ビロードキビ(alexandergrass (Bracharia plantaginea)), ギネアキビ (guineagrass (Panicum maximum Jacq.))、パラグラス(paragrass (Panicum purpurascens)), オオクサキビ (smooth witchgrass (Panicum dichotomiflorum)), アゼガヤ(sprangletop (Leptochloa chinensis)), イトアゼガヤ(red sprangletop (Leptochloa panicea)), スズメノカタビラ(annual bluegrass (Poa annua L.)), スズメノテッポウ(black grass (Alopecurus myosuroides Huds.)), カモジグサ(cholorado bluestem (Agropyron tsukushiense (Honda) Ohwi)), メリケンニクキビ(broadleaf signalgrass(Brachiariaplathyphylla Nash)), シンクリノイガ(southern sand bur (Cenchrusechinatus L.)), ネズミムギ(italian ryegrass (Lolium multiflorum Lam.)), ギョウギシバ(bermudagrass (Cynodondactylon Pers.))のようなイネ科雑草(gramineae) ; コゴメガヤツリ(rice flatsedge (Cyperus iria L.)), ハマスゲ(purple nutsedge (Cyperus rotundus L.)), キハマスゲ(yellow nutsedge (Cyperus esculentus L.)), ホタルイ(Japanese bulrush (Scirpus juncooides)), ミズガヤツリ(flatsedge (Cyperus serotinus)), タマガヤツリ(small-flower umbrellaplant (Cyperus difformis)), マツバイ(slender spikerush (Eleocharis acicularis)), クログワイ(water chestnut (Eleocharis kuroguwai))のようなカヤツリグサ科雑草(cyperaceae) ; ウリカワ(Japanese ribbon waparo (Sagittariapygmaea)), オモダカ(arrow-head (Sagittaria trifolia)), ヘラオモダカ(narrowleaf waterplantain (Alisma canaliculatum))のようなオモダカ科雑草(alismataceae) ; コナギ(monochoria (Monochoriavaginalis)), ミズアオイ(monochoria species (Monochoriakorsakowii))のようなミズアオイ科雑草(pontederiaceae) ; アゼナ(false pimpinell (Lindernia pyxidaria))のようなアゼトウガラシ科雑草、アブノメ(abunome (Dopatrium junceum))のようなオオバコ科雑草(plantaginaceae) ; キ

カシグサ(toothcup (Rotalaindia)), ヒメミソハギ(red stem (Ammannia multiflora))のようなミソハギ科雑草(lythraceae) ; ミゾハコベ(long stem waterwort(Elatinetriaandra SCHK.))のようなミゾハコベ科雑草(elatinaceae) ; イチビ(velvetleaf (Abutilon theophrastiMEDIC.)), アメリカキンゴジカ(prickly sida (Sida spinosaL.))のようなアオイ科雑草(malvaceae) ; オナモミ(common cocklebur (Xanthiumstrumarium L.)), ブタクサ(common ragweed (Ambrosiaelator L.)), エゾノキツネアザミ(thistle (Breea setosa(BIEB.) KITAM.)), ハキダメギク(hairy galinsoga(Galinsogaciliata Blake)), カミツレ(wild chamomile(Matricariachamomilla L.)), ホトケノザ(henbit (Lamium amplexicauleL.)), セイヨウタンポポ (common dandelion (Taraxacumofficinale weber))、ヒメムカシヨモギ (horseweed (ErigeronCanadensis L.)) のようなキク科雑草(compositae) ; イヌホウズキ(black nightshade (Solanum nigrum L.)), シロバナチョウセンアサガオ(jimsonweed (Datura stramonium))のようなナス科雑草(solanaceae) ; アオビユ(slender amaranth (Amaranthusviridis L.)), アオゲイトウ(redroot pigweed (Amaranthusretroflexus L.)), シロザ(common lambsquarters (Chenopodium album L.)), ホウキギ(mexican burningbush(Kochia scoparia Schrad.))のようなヒユ科雑草(amaranthaceae) ; サナエタデ(pale smartweed (Polygonum lapathifolium L.)), ハルタデ (ladysthumb (Polygonum persicaria L.))、ソバカズラ(wild buckwheat(Polygonum convolvulus L.))、ミチヤナギ(knotweed(Polygonum aviculare L.))のようなタデ科雑草 (polygonaceae) ; タネツケバナ(flexuous bittercress (Cardamineflexuosa WITH.)), ナズナ (shepherd's-purse(Capsellabursapastoris Medik.))、セイヨウカラシナ(indian mustard (Brassica juncea Czern.))のようなアブラナ科雑草 (cruciferae) ; マルバアサガオ(tall morningglory (Ipomoea purpurea L.)), セイヨウヒルガオ(field bindweed (Convolvulus arvensis L.)), アメリカアサガオ (ivy leaf morningglory (Ipomoea hederacea Jacq.)) のようなヒルガオ科雑草(convolvulaceae) ; スベリヒユ(common purslane (Portulaca oleracea L.))のような

スベリヒユ科雑草 (Portulacaceae) ; エビスグサ(sicklepod (Cassia obtusifolia L.))のようなマメ科雑草 (fabaceae) ; ハコベ(common chickweed (Stellaria media L.))のようなナデシコ科雑草 (caryophyllaceae) ; ヤエムグラ(catchweed (Galium spurium L.))のようなアカネ科雑草 (rubiacae) ; エノキグサ(threeseeded copperleaf (Acalypha australis L.))のようなトウダイグサ科雑草 (euphorbiaceae) ; ツユクサ (common dayflower (Commelina communis L.)) のようなツユクサ科雑草 (Commelinaceae) などの各種有害雑草を防除することができる。よって、有用作物、例えばトウモロコシ(corn (Zea mays L.))、ダイズ(soybean (Glycine max Merr.))、ワタ (cotton (Gossypium spp.))、コムギ(wheat (Triticum spp.))、イネ(rice (Oryza sativa L.))、オオムギ(barley (Hordeum Vulgare L.))、ライムギ(rye (Secale cereale L.))、エンバク(oat (Avena sativa L.))、ソルガム(sorgo (Sorghum bicolor Moench))、アブラナ(rape (Brassica napus L.))、ヒマワリ(sunflower (Helianthus annuus L.))、テンサイ(sugar beet (Beta Vulgaris L.))、サトウキビ(sugar cane (Saccharum officinarum L.))、芝(japanese lawn grass (Zoysia japonica Steud.))、ピーナッツ(peanut (Arachis hypogaea L.))、アマ(flax (Linum usitatissimum L.))、タバコ(tobacco (Nicotiana tabacum L.))、コーヒー(coffee (Coffea spp.))などの栽培において、選択的に有害雑草を防除する場合或いは非選択的に有害雑草を防除する場合において有効に使用される。

[0150] 本発明化合物は、通常、各種農業上の補助剤と混合して粉剤、粒剤、顆粒水和剤、水和剤、錠剤、丸剤、カプセル剤（水溶性フィルムで包装する形態を含む）、水性懸濁剤、油性懸濁剤、マイクロエマルジョン製剤、サスポエマルジョン製剤、水溶剤、乳剤、液剤、ペースト剤などの種々の形態に製剤調製し、施用することができるが、本発明の目的に適合する限り、通常の当該分野で用いられているあらゆる製剤形態にすることができる。

[0151] 製剤に使用する補助剤としては、珪藻土、消石灰、炭酸カルシウム、タルク、ホワイトカーボン、カオリン、ベントナイト、カオリナイト及びセリサ

イトの混合物、クレー、炭酸ナトリウム、重曹、芒硝、ゼオライト、澱粉などの固形担体；水、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、ジオキサン、アセトン、イソホロン、メチルイソブチルケトン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、アルコールなどの溶剤；脂肪酸塩、安息香酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリカルボン酸塩、アルキル硫酸エステル塩、アルキル硫酸塩、アルキルアリール硫酸塩、アルキルジグリコールエーテル硫酸塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、アリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルジフェニルエーテルジスルホン酸塩、ポリスチレンスルホン酸塩、アルキルリン酸エステル塩、アルキルアリールリン酸塩、スチリルアリールリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールリン酸エステル塩、ポリオキシエチレンアリールエーテルリン酸エステル塩、ナフタレンスルホン酸塩ホルマリン縮合物、アルキルナフタレンスルホン酸塩ホルマリン縮合物のような陰イオン系の界面活性剤や展着剤；ソルビタン脂肪酸エステル、グリセリン脂肪酸エステル、脂肪酸ポリグリセライド、脂肪酸アルコールポリグリコールエーテル、アセチレングリコール、アセチレンアルコール、オキシアлкиレンブロックポリマー、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アリールエーテル、ポリオキシエチレングリコールアルキルエーテル、ポリエチレングリコール、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレングリセリン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシプロピレン脂肪酸エステルのような非イオン系の界面活性剤や展着剤；オリーブ油、カボック油、ひまし油、シュロ油、椿油、ヤシ油、ごま油、トウ

モロコシ油、米ぬか油、落花生油、綿実油、大豆油、菜種油、亜麻仁油、きり油、液状パラフィンなどの植物油や鉱物油などが挙げられる。これら補助剤は本発明の目的から逸脱しない限り、1種又は2種以上を適宜選択して使用することができ、また、例えば、増量剤、増粘剤、沈降防止剤、凍結防止剤、分散安定剤、薬害軽減剤、防黴剤、発泡剤、崩壊剤、結合剤など、通常使用される各種補助剤も使用することができる。本発明化合物と各種補助剤との配合割合は、通常、0.1 : 99.9 ~ 95 : 5、望ましくは0.2 : 99.8 ~ 85 : 15である。尚、本発明化合物と各種補助剤との配合方法は、特に検定されるものではなく、公知の方法に準じて適宜配合することができる。

[0152] 本発明化合物を含有する除草剤の施用量（除草有効量）は、気象条件、土壌条件、製剤形態、対象となる望ましくない植物の種類、施用時期などの相違により一概に規定できないが、一般に1ヘクタール当り本発明化合物が0.1 ~ 5,000 g、望ましくは0.5 ~ 3,000 g、更に望ましくは1 ~ 1,000 gとなるように施用する。本発明には、このような除草剤の施用による望ましくない植物の防除方法も含まれる。

[0153] また、本発明化合物を含有する除草剤は、他の農薬、肥料、薬害軽減剤などと混用或いは併用することができ、この場合に一層優れた効果、作用性を示すことがある。他の農薬としては、除草剤、殺菌剤、抗生物質、植物ホルモン、殺虫剤などが挙げられる。特に、本発明化合物と、他の除草剤の有効成分である化合物の1種又は2種以上とを混用或いは併用した混合除草性組成物は、適用草種の範囲、薬剤処理の時期、除草活性などを好ましい方向へ改良することが可能である。尚、本発明化合物と他の除草剤の有効成分である化合物は、各々別々に製剤したものを散布時に混合して使用してもよく、両者を一緒に製剤して使用してもよい。本発明には、上記混合除草性組成物も含まれる。

[0154] 本発明化合物と他の除草剤の有効成分である化合物との混合比は、気象条件、土壌条件、薬剤の製剤形態、施用時期、施用方法などの相違により一概に規定できないが、本発明化合物1重量部に対し、他の除草剤は有効成分で

ある化合物を1種あたり0.001~10,000重量部、望ましくは0.01~1,000重量部配合する。また、施用適量は1ヘクタール当りの有効成分の総化合物量として0.1~10,000g、望ましくは0.2~5,000g、更に望ましくは10~3,000gである。本発明には、このような混合除草組成物の施用による望ましくない植物の防除方法も含まれる。

[0155] 他の除草剤の有効成分である化合物としては、下記化合物（一般名；一部ISO申請中を含む）を例示することができるが、特に記載がない場合であっても、これら化合物に塩、アルキルエステルなどが存在する場合は、当然それらも含まれる。

[0156] (1) 2,4-D、2,4-Dブチル (2,4-D-butetyl)、2,4-Dブチル (2,4-D-butyl)、2,4-Dジメチルアンモニウム (2,4-D-dimethylammonium)、2,4-Dジオールアミン (2,4-D-diolamine)、2,4-Dエチル (2,4-D-ethyl)、2,4-D-2-エチルヘキシル (2,4-D-2-ethylhexyl)、2,4-Dイソブチル (2,4-D-isobutyl)、2,4-Dイソオクチル (2,4-D-isooctyl)、2,4-Dイソプロピル (2,4-D-isopropyl)、2,4-Dイソプロピルアンモニウム (2,4-D-isopropylammonium)、2,4-Dナトリウム (2,4-D-sodium)、2,4-Dイソプロパノールアンモニウム (2,4-D-isopropanolammonium)、2,4-Dトロールアミン (2,4-D-trolamine)、2,4-DB、2,4-DBブチル (2,4-DB-butyl)、2,4-DBジメチルアンモニウム (2,4-DB-dimethylammonium)、2,4-DBイソオクチル (2,4-DB-isooctyl)、2,4-DBカリウム (2,4-DB-potassium)、2,4-DBナトリウム (2,4-DB-sodium)、2,4-Dコリン塩 (2,4-D choline salt)、ジクロロプロップ (dichlorprop)、ジクロロプロップブチル (dichlorprop-butetyl)、ジクロロプロップジメチルアンモニウム (dichlorprop-dimethylammonium)、ジクロロプロップイソオクチル (dichlorprop-isooctyl)、ジクロロプロップカリウム (dichlorprop-potassium)、ジクロロプロップ-P (dichlorprop-P)、ジクロロプロップ-P-ジメチルアンモニウム (dichlorprop-P-dimethylammonium)、ジクロロプロップ-P-カリウム (d

ichlorprop-P-potassium)、ジクロロプロップ-P-ナトリウム (dichlorprop-P-sodium)、MCPA、MCPAブトチル (MCPA-butotyl)、MCPAジメチルアンモニウム (MCPA-dimethylammonium)、MCPA-2-エチルヘキシル (MCPA-2-ethylhexyl)、MCPAカリウム (MCPA-potassium)、MCPAナトリウム (MCPA-sodium)、MCPAチオエチル (MCPA-thioethyl)、MCPB、MCPBエチル (MCPB-ethyl)、MCPBナトリウム (MCPB-sodium)、メコプロップ (mecoprop)、メコプロップブトチル (mecoprop-butotyl)、メコプロップナトリウム (mecoprop-sodium)、メコプロップ-P (mecoprop-P)、メコプロップ-P-ブトチル (mecoprop-P-butotyl)、メコプロップ-P-ジメチルアンモニウム (mecoprop-P-dimethylammonium)、メコプロップ-P-2-エチルヘキシル (mecoprop-P-2-ethylhexyl)、メコプロップ-P-カリウム (mecoprop-P-potassium)、ナプロアニリド (naproanilide)、クロメプロップ (clomeprop)、HIA-1のようなフェノキシ系化合物；2, 3, 6-TBA、ジカンバ (dicamba)、ジカンバブトチル (dicamba-butotyl)、ジカンバジグリコールアミン (dicamba-diglycolamine)、ジカンバジメチルアンモニウム (dicamba-dimethylammonium)、ジカンバジオールアミン (dicamba-diolamine)、ジカンバイソプロピルアンモニウム (dicamba-isopropylammonium)、ジカンバカリウム (dicamba-potassium)、ジカンバナトリウム (dicamba-sodium)、ピクロラム (picloram)、ピクロラムジメチルアンモニウム (picloram-dimethylammonium)、ピクロラムイソオクチル (picloram-isooctyl)、ピクロラムカリウム (picloram-potassium)、ピクロラムトリイソプロパノールアンモニウム (picloram-triisopropanolammonium)、ピクロラムトリイソプロピルアンモニウム (picloram-triisopropylammonium)、ピクロラムトロールアミン (picloram-trolamine)、トリクロピル (triclopyr)、トリクロピルブトチル (triclopyr-butotyl)、トリクロピルトリエチルアンモニウム (triclopyr-triethylammonium)、クロピラリド (clopyralid)、クロピラリドオールアミン (clopyralid-olamine)、クロピラリドカリウム (clopyralid-potassium)、クロピラリドトリイソプロ

パノールアンモニウム (clopyralid-triisopropanolammonium)、アミノピラリド (aminopyralid)、アミノシクロピラクロール (aminocyclopyrachlor)、ハロウキシフェン (halauxifen)、ハロウキシフェンメチル (halauxifen-methyl) のような芳香族カルボン酸系化合物；その他、ナプタラム (naptalam)、ナプタラムナトリウム (naptalam-sodium)、ベナゾリン (benazolin)、ベナゾリンエチル (benazolin-ethyl)、キンクロラック (quinclorac)、キンメラック (quinmerac)、ダイフルフェンゾピル (diflufenzopyr)、ダイフルフェンゾピルナトリウム (diflufenzopyr-sodium)、フルオキシピル (fluroxypyr)、フルオキシピルー 2-ブトキシ-1-メチルエチル (fluroxypyr-2-butoxy-1-methylethyl)、フルオキシピルメプチル (fluroxypyr-methyl)、クロロフルレノール (chlorflurenol)、クロロフルレノールメチル (chlorflurenol-methyl)、クラシフォス (clacyfos) などのように植物のホルモン作用を攪乱することで除草効力を示すとされている化合物。

[0157] (2) クロロトルロン (chlorotoluron)、ジウロン (diuron)、フルオメツロン (fluometuron)、リニュロン (linuron)、イソプロチュロン (isoproturon)、メトベンズロン (metobenzuron)、テブチウロン (tebuthiuron)、ジメフロン (dimefuron)、イソウロン (isouron)、カルブチレート (karbutilate)、メタベンズチアズロン (methabenzthiazuron)、メトクスロン (metoxuron)、メトブロムロン (metoburomuron)、モノリニュロン (monolinuron)、ネブロン (neburon)、シデュロン (siduron)、ターブメトン (terbumeton)、トリエタジン (trietazine) のような尿素系化合物；シマジン (simazine)、アトラジン (atrazine)、アトラトン (atratone)、シメトリン (simetryn)、プロメトリン (prometryn)、ジメタメトリン (dimethametryn)、ヘキサジノン (hexazinone)、メトリブジン (metribuzin)、ターブチラジン (terbuthylazine)、シアナジン (cyanazine)、アメトリン (ametryn)、シブトリン (cybutryne)、ターブトリン (terbutryn)、プロパジン (propazine)、メタミトロン (metamitron)、プロメトン (prometon) のようなトリアジン系化合物；ブロマシル (bromacil)、ブロマシルリチウム

(bromacyl-lithium)、レナシル (lenacil)、ターバシル (terbacil) のようなウラシル系化合物；プロパニル (propanil)、シプロミッド (cypromid) のようなアニリド系化合物；スエップ (swep)、デスメディファム (desmedipham)、フェンメディファム (phenmedipham) のようなカーバメート系化合物；ブロモキシニル (bromoxynil)、ブロモキシニルオクタノエート (bromoxynil-octanoate)、ブロモキシニルヘプタノエート (bromoxynil-heptanoate)、アイオキシニル (ioxynil)、アイオキシニルオクタノエート (ioxynil-octanoate)、アイオキシニルカリウム (ioxynil-potassium)、アイオキシニルナトリウム (ioxynil-sodium) のようなヒドロキシベンゾニトリル系化合物；その他、ピリデート (pyridate)、ベンタゾン (bentazone)、ベンタゾンナトリウム (bentazone-sodium)、アミカルバゾン (amicarbazone)、メタゾール (methazole)、ペンタノクロール (pentanochlor)、フェンメディファム (phenmedipham) などのように植物の光合成を阻害することで除草効力を示すとされている化合物。

[0158] (3) それ自身が植物体中でフリーラジカルとなり、活性酸素を生成させて速効的な除草効力を示すとされているパラコート (paraquat)、ジクワット (diquat) のような4級アンモニウム塩系化合物。

[0159] (4) ニトロフェン (nitrofen)、クロメトキシフェン (chlomethoxyfen)、ビフェノックス (bifenox)、アシフルオルフェン (acifluorfen)、アシフルオルフェンナトリウム (acifluorfen-sodium)、ホメサフェン (fomesafen)、ホメサフェンナトリウム (fomesafen-sodium)、オキシフルオルフェン (oxyfluorfen)、ラクトフェン (lactofen)、アクロニフェン (aclonifen)、エトキシフェンエチル (ethoxyfen-ethyl)、フルオログリコフェンエチル (fluoroglycofen-ethyl)、フルオログリコフェン (fluoroglycofen) のようなジフェニルエーテル系化合物；クロルフタリム (chlorophthalim)、フルミオキサジン (flumioxazin)、フルミクロラック (flumiclorac)、フルミクロラックペンチル (flumiclorac-pentyl)、シニドンエチル (cinidon-ethyl)、フルチアセットメチル (fluthiacet-methyl)、EK-5385のよう

な環状イミド系化合物；その他、オキサジアルギル (oxadiargyl)、オキサジアゾン (oxadiazon)、スルフエントラゾン (sulfentrazone)、カルフェントラゾンエチル (carfentrazone-ethyl)、チジアジミン (thidiazimin)、ペントキサゾン (pentoxazone)、アザフェニジン (azafenidin)、イソプロパゾール (isopropazole)、ピラフルフェンエチル (pyraflufen-ethyl)、ベンズフェンジゾン (benzfendizone)、ブタフェナシル (butafenacil)、サフルフェナシル (saflufenacil)、フルアゾレート (fluazolate)、プロフルアゾール (profluazol)、フルフェンピルエチル (flufenpyr-ethyl)、ベンカルバゾン (bencarbazon)、チアフェナシル (tiafenacil)、ピラクロニル (pyrachlonil)、HNPC-B4047、IR-6396、EK-5439、EK-5498、SYN-523、W02008/008763 (FMC) に記載の化合物などのように植物のクロロフィル生成を阻害し、光増感過酸化物質を植物体中に異常蓄積させることで除草効力を示すとされている化合物。

- [0160] (5) ノルフルラゾン (norflurazon)、クロリダゾン (chloridazon)、メトフルラゾン (metflurazon) のようなピリダジノン系化合物；ピラゾリネート (pyrazolynate)、ピラゾキシフェン (pyrazoxyfen)、ベンゾフェナップ (benzofenap)、トプラメゾン (topramezone)、ピラスルフォトール (pyrasulfotole) のようなピラゾール系化合物；その他、アミトロール (amitrole)、フルリドン (fluridone)、フルルタモン (flurtamone)、ジフルフェニカン (diflufenican)、メトキシフェノン (methoxyphenone)、クロマゾン (clomazone)、スルコトリオン (sulcotrione)、メソトリオン (mesotrione)、テンボトリオン (tembotrione)、テフリルトリオン (tefuryltrione)、フェンキノトリオン (fenquinotrione)、シクロピリモレート (cyclopyrimorate)、イソキサフルトール (isoxaflutole)、ジフェンゾコート (difenzoquat)、ジフェンゾコートメチルサルフェート (difenzoquat-metilsulfate)、イソキサクロロトール (isoxachlortole)、ベンゾビシクロン (benzobicyclon)、ビシクロピロン (bicyclopyron)、ピコリナフェン (picolinafen)、ビフルブタミド (beflubutamid)、ケトスピラドックス (ketospiradox

）、ケトスピラドックスカリウム (ketospiradox-potassium)、JP2012/2571 (住友化学) に記載の化合物などのようにカロチノイドなどの植物の色素合成を阻害し、白化作用を特徴とする除草効力を示すとされている化合物。

[0161] (6) ジクロホップメチル (diclofop-methyl)、ジクロホップ (diclofop)、ピリフェノップナトリウム (pyriphenop-sodium)、フルアジホップブチル (fluazifop-butyl)、フルアジホップ (fluazifop)、フルアジホップーP (fluazifop-P)、フルアジホップーPーブチル (fluazifop-P-butyl)、ハロキシホップメチル (haloxyfop-methyl)、ハロキシホップ (haloxyfop)、ハロキシホップエトチル (haloxyfop-etotyl)、ハロキシホップーP (haloxyfop-P)、ハロキシホップーPーメチル (haloxyfop-P-methyl)、キザロホップエチル (quizalofop-ethyl)、キザロホップーP (quizalofop-P)、キザロホップーPーエチル (quizalofop-P-ethyl)、キザロホップーPーテフリル (quizalofop-P-tefuryl)、シハロホップブチル (cyhalofop-butyl)、フェノキサプロップエチル (fenoxaprop-ethyl)、フェノキサプロップーP (fenoxaprop-P)、フェノキサプロップーPーエチル (fenoxaprop-P-ethyl)、メタミホッププロピル (metamifop-propyl)、メタミホップ (metamifop)、クロジナホッププロパルギル (clodinafop-propargyl)、クロジナホップ (clodinafop)、プロパキザホップ (propaquizafof)、HNPC-A8169、SYP-1924のようなアリールオキシフェノキシプロピオン酸系化合物；アロキシジムナトリウム (alloxydim-sodium)、アロキシジム (alloxydim)、クレソジム (clethodim)、セトキシジム (sethoxydim)、トラルコキシジム (tralkoxydim)、ブトロキシジム (butoxydim)、テプラロキシジム (tepraloxym)、プロホキシジム (profoxydim)、シクロキシジム (cycloxydim) のようなシクロヘキサジオン系化合物；ピノキサデン (pinoxaden) のようなフェニルピラゾリン系化合物；などのように脂肪酸の生合成を阻害し、植物に除草効力を示すとされている化合物。

[0162] (7) クロリムロンエチル (chlorimuron-ethyl)、クロリムロン (chlorimuron)、スルホメツロンメチル (sulfometuron-methyl)、スルホメツロン

(sulfometuron)、プリミスルフロンメチル (primisulfuron-methyl)、プリミスルフロン (primisulfuron)、ベンスルフロンメチル (bensulfuron-methyl)、ベンスルフロン (bensulfuron)、クロルスルフロン (chlorsulfuron)、メトスルフロンメチル (metsulfuron-methyl)、メトスルフロン (metsulfuron)、シノスルフロン (cinosulfuron)、ピラゾスルフロンエチル (pyrazosulfuron-ethyl)、ピラゾスルフロン (pyrazosulfuron)、フラザスルフロン (flazasulfuron)、リムスルフロン (rimsulfuron)、ニコスルフロン (nicosulfuron)、イマゾスルフロン (imazosulfuron)、フルセトスルフロン (flucetosulfuron)、シクロスルファムロン (cyclosulfamuron)、プロスルフロン (prosulfuron)、フルピルスルフロンメチルナトリウム (flupyrsulfuron-methyl-sodium)、フルピルスルフロン (flupyrsulfuron)、トリフルスルフロンメチル (triflusulfuron-methyl)、トリフルスルフロン (triflusulfuron)、ハロスルフロンメチル (halosulfuron-methyl)、ハロスルフロン (halosulfuron)、チフェンスルフロンメチル (thifensulfuron-methyl)、チフェンスルフロン (thifensulfuron)、エトキシスルフロン (ethoxysulfuron)、オキサスルフロン (oxasulfuron)、エタメトスルフロン (ethametsulfuron)、エタメトスルフロンメチル (ethametsulfuron-methyl)、イオドスルフロン (iodosulfuron)、イオドスルフロンメチルナトリウム (iodosulfuron-methyl-sodium)、スルフォスルフロン (sulfosulfuron)、トリアスルフロン (triasulfuron)、トリベヌロンメチル (tribenuron-methyl)、トリベヌロン (tribenuron)、トリトスルフロン (tritosulfuron)、フォーラムスルフロン (foramsulfuron)、トリフルオキシスルフロン (trifloxysulfuron)、トリフルオキシスルフロンナトリウム (trifloxysulfuron-sodium)、メソスルフロンメチル (mesosulfuron-methyl)、メソスルフロン (mesosulfuron)、オルソスルファムロン (orthosulfamuron)、アミドスルフロン (amidosulfuron)、アジムスルフロン (azimsulfuron)、プロピリスルフロン (propyrisulfuron)、メタゾスルフロン (metazosulfuron)、メチオピルスルフロン (methiopyrsulfuron)、モノスルフロンメチル (monosulfuron-

methyl)、オルソスルフロン(orsosulfuron)、イオフエンスルフロン (iofensulfuron)、イオフエンスルフロンナトリウム (iofensulfuron-sodium) のようなスルフォニルウレア化合物；フルメツラム (flumetsulam)、メトスラム (metosulam)、ジクロスラム (diclosulam)、クロランスラムメチル (cloransulam-methyl)、フロラスラム (florasulam)、ペノクススラム (penoxsulam)、ピロクススラム (pyroxsulam) のようなトリアゾロピリミジンスルホンアミド系化合物；イマザピル (imazapyr)、イマザピルイソプロピルアンモニウム (imazapyr-isopropylammonium)、イマゼタピル (imazethapyr)、イマゼタピルアンモニウム (imazethapyr-ammonium)、イマザキン (imazaquin)、イマザキンアンモニウム (imazaquin-ammonium)、イマザモックス (imazamox)、イマザモックスアンモニウム (imazamox-ammonium)、イマザメタバ enz (imazamethabenz)、イマザメタバ enzメチル (imazamethabenz-methyl)、イマザピック (imazapic) のようなイミダゾリノン系化合物；ピリチオバックナトリウム (pyrithiobac-sodium)、ビスピリバックナトリウム (bispiribac-sodium)、ピリミノバックメチル (pyriminobac-methyl)、ピリベンゾキシム (pyribenzoxim)、ピリフタリド (pyriftalid)、ピリミスルファン (pyrimisulfan)、トリアファモン (triafamone) のようなピリミジニルサリチル酸系化合物；フルカーバゾン (flucarbazon)、フルカーバゾンナトリウム (flucarbazon-sodium)、プロポキシカーバゾンナトリウム (propoxycarbazon-sodium)、プロポキシカーバゾン (propoxycarbazon)、チエンカルバゾンメチル (thiencarbazon-methyl) のようなスルホニルアミノカルボニルトリアゾリノン系化合物；その他、グリホサート (glyphosate)、グリホサートナトリウム (glyphosate-sodium)、グリホサートカリウム (glyphosate-potassium)、グリホサートアンモニウム (glyphosate-ammonium)、グリホサートジアンモニウム (glyphosate-diammonium)、グリホサートイソプロピルアンモニウム (glyphosate-isopropylammonium)、グリホサートトリメシウム (glyphosate-trimesium)、グリホサートセスキナトリウム (glyphosate-sesquisodium)、グルホシネート (glufosinate)、グルホシ

ネートアンモニウム (glufosinate-ammonium)、グルホシネート-P (glufosinate-P)、グルホシネート-P-アンモニウム (glufosinate-P-ammonium)、グルホシネート-P-ナトリウム (glufosinate-P-sodium)、ビラナホス (bilarafos)、ビラナホスナトリウム (bilarafos-sodium)、シンメチリン (cinmethylin) などのように植物のアミノ酸生合成を阻害することで除草効力を示すとされている化合物。

[0163] (8) トリフルラリン (trifluralin)、オリザリン (oryzalin)、ニトラリン (nitralin)、ペンディメタリン (pendimethalin)、エタルフルラリン (ethalfluralin)、ベンフルラリン (benfluralin)、プロジアミン (prodi amine)、ブトラリン (butralin)、ジニトラミン (dinitramine) のようなジニトロアニリン系化合物；ベンスリド (bensulide)、ナプロパミド (napropamide)、ナプロパミド-M (napropamide-M)、プロピザミド (propyzamide)、プロナミド (pronamide) のようなアミド系化合物；アミプロホスメチル (amiprofos-methyl)、ブタミホス (butamifos)、アニロホス (anilofos)、ピペロホス (piperophos) のような有機リン系化合物；プロファム (proph am)、クロルプロファム (chlorpropham)、バーバン (barban)、カルベタミド (carbetamide) のようなフェニルカーバメート系化合物；ダイムロン (daimuron)、クミルロン (cumluron)、ブロモブチド (bromobutide)、メチルダイムロン (methyldymron) のようなクミルアミン系化合物；その他、アシュラム (asulam)、アシュラムナトリウム (asulam-sodium)、ジチオピル (dithiopyr)、チアゾピル (thiazopyr)、クロルタールジメチル (chlor thal-dimethyl)、クロルタール (chlorthal)、ジフェナミド (diphenamid)、フラムプロップ-M-メチル (flamprop-M-methyl)、フラムプロップ-M (flamprop-M)、フラムプロップ-M-イソプロピル (flamprop-M-isopropyl) などのように植物の細胞有糸分裂を阻害することで除草効力を示すとされている化合物。

[0164] (9) アラクロール (alachlor)、メタザクロール (metazachlor)、ブタクロール (butachlor)、プレチラクロール (pretilachlor)、メトラクロー

ル (metolachlor)、S-メトラクロール (S-metolachlor)、テニルクロール (thenylchlor)、ペトキサミド (pethoxamid)、アセトクロール (acetochlor)、プロパクロール (propachlor)、ジメテナミド (dimethenamide)、ジメテナミド-P (dimethenamide-P)、プロピソクロール (propisochlor)、ジメタクロール (dimethachlor) のようなクロロアセトアミド系化合物；モリネート (molinate)、ジメピペレート (dimepiperate)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、EPTC、ブチレート (butylate)、ベルノレート (vernolate)、ペブレート (pebulate)、シクロエート (cycloate)、プロスルホカルブ (prosulfocarb)、エスプロカルブ (esprocarb)、チオベンカルブ (thiobencarb)、ジアレート (diallate)、トリアレート (tri-allate)、オルベンカルブ (orbencarb) のようなチオカーバメート系化合物；その他、エトベンザニド (etobenzanid)、メフェナセット (mefenacet)、フルフェナセット (flufenacet)、トリディファン (tridiphane)、カフェンストロール (cafenstrole)、フェントラザミド (fentrazamide)、オキサジクロメフォン (oxaziclomefone)、インダノファン (indanofan)、ベンフレセート (benfuresate)、ピロキサスルフォン (pyroxasulfone)、フェノキサスルフォン (fenoxasulfone)、メチオゾリン (methiozolin)、ダラポン (dalapon)、ダラポンナトリウム (dalapon-sodium)、TCAナトリウム (TCA-sodium)、トリクロロ酢酸 (trichloroacetic acid) などのように植物のタンパク質生合成あるいは脂質生合成を阻害することで除草効力を示すとされている化合物。

[0165] (10) ジクロベニル (dichlobenil)、トリアジフラム (triaziflam)、インダジフラム (indaziflam)、フルポキサム (flupoxam)、イソキサベン (isoxaben) などのように植物のセルロース生合成を阻害することで除草効力を示すとされている化合物。

[0166] (11) MSMA、DSMA、CMA、エンドタール (endothall)、エンドタールジカリウム (endothall-dipotassium)、エンドタールナトリウム (endothall-sodium)、エンドタールモノ (N, N-ジメチルアルキルアンモ

ニウム) (endothall-mono(N,N-dimethylalkylammonium))、エトフメセート (ethofumesate)、ソディウムクロレート (sodium chlorate)、ペラルゴン酸 (pelargonic acid)、ノナン酸 (nonanoic acid)、ホスアミン (fosamine)、ホスアミンアンモニウム (fosamine-ammonium)、イプフェンカルバゾン (ipfencarbazon)、アクロレイン (acrolein)、スルファミン酸アンモニウム (ammonium sulfamate)、ボラックス (borax)、クロロ酢酸 (chloroacetic acid)、クロロ酢酸ナトリウム (sodium chloroacetate)、シアナミド (cyanamide)、メチルアルソン酸 (methylarsonic acid)、ジメチルアルソン酸 (dimethylarsinic acid)、ジメチルアルソン酸ナトリウム (sodium dimethylarsinate)、ジノターブ (dinoterb)、ジノターブアンモニウム (dinoterb-ammonium)、ジノターブジオールアミン (dinoterb-diolamine)、ジノターブアセテート (dinoterb-acetate)、D N O C、硫酸第一鉄 (ferrous sulfate)、フルプロパネート (flupropanate)、フルプロパネートナトリウム (flupropanate-sodium)、メフルイジド (mefluidide)、メフルイジドジオールアミン (mefluidide-diolamine)、メタム (metam)、メタムアンモニウム (metam-ammonium)、メタムカリウム (metam-potassium)、メタムナトリウム (metam-sodium)、イソチオシアン酸メチル (methyl isothiocyanate)、ペンタクロロフェノール (pentachlorophenol)、ペンタクロロフェノールナトリウム (sodium pentachlorophenoxide)、ペンタクロロフェノールラウレート (pentachlorophenol laurate)、キノクラミン (quinoclamine)、硫酸 (sulfuric acid)、ウレアサルフェート (urea sulfate)、ザンチノシン (xanthinosin)、ハービマイシン (herbimycin)、アングイノール (anguinol)、メタチロシン (metatyrosine)、サルメンチン (sarmentine)、タキシトミンA (thaxtomin A)、メバロシジン (mevalocidin)、 α -リモネン (alpha-limonene)、ピリバムベンズプロピル (pyribambenz-propyl)、ピリバムベンズイソプロピル (pyribambenz-isopropyl)、JS-913、KHG-23844、H-9201、SIOC-0163、SIOC-0171、SIOC-0172、SIOC-0285、SIOC-0426、SIOC-H-057、ZJ-0166、ZJ-1835、ZJ-0453、ZJ-0777、ZJ-0862、W02008/096398 (

クミアイ化学)に記載の化合物などのその他の除草剤。

[0167] (12) ザントモナス キャンペストリス (Xanthomonas campestris)、エピココロシルス ネマトソルス (Epicoccossirus nematosorus)、エピココロシルス ネマトスペラス (Epicoccossirus nematosperus)、エキセロヒラムモノセラス (Exserohilum monoseras)、ドレクスレラ モノセラス (Drechsre la monoceras) などのように植物に寄生することで除草効力を示すとされているもの。

[0168] 他の除草剤の有効成分である上記化合物は、1種又は2種以上を適宜選択することができる。尚、他の除草剤の有効成分は、上記例示の化合物に限定されるものではない。

実施例

[0169] 以下、実施例に従って本発明をより具体的に説明するが、本発明は実施例のみに限定されて解釈されるものではない。まず、本発明化合物の合成例を記載する。

[0170] ・合成例 1

1,1,1-トリフルオロ-N-(4-((2-オキシピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド (化合物No.1-1) の合成

(1) 4-アミノ-3-チオフェンカルボン酸メチル塩酸塩 (2.00 g) をクロロホルム (100 ml) に溶解させ、窒素雰囲気下、室温下でナトリウムトリアセトキシボロヒドリド (3.30 g)、2,4-ジメトキシベンズアルデヒド (1.60 g)、酢酸 (1.10 ml) を加えて12時間攪拌した。0℃に冷却し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて反応を停止させ、水層をクロロホルムで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥させて溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (ヘプタン：酢酸エチル=9：1～8：2) で精製し、メチル 4-((2,4-ジメトキシベンジル)アミノ)チオフェン-3-カルボキシレート (2.13 g) を褐色オイルとして得た。¹H-NMR (500 MHz, acetone-d₆, δ ppm) : 8.05 (d, 1H), 7.20 (d, 1H), 6.54 (s, 1H), 6.44 (d, 1H), 5.98 (d, 1H), 4.20 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.78 (s, 3H)

), 3.75 (s, 3H).

(2) 上記(1)で合成したメチル 4-((2,4-ジメトキシベンジル)アミノ)チオフェン-3-カルボキシレート (1.40 g) 及びジイソプロピルアミン (1.00 ml) をクロロホルム (20 ml) に溶解させ、窒素雰囲気下、0℃でトリフルオロメタンスルホン酸無水物 (0.96 ml) を滴下した。この溶液を室温まで昇温しながら、さらに1時間攪拌した。反応溶液を水で洗浄し、水層をクロロホルムで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥させて溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (ヘプタン：酢酸エチル=9：1～8：2) で精製し、メチル 4-(N-(2,4-ジメトキシベンジル)-1,1,1-トリフルオロメチルスルホンアミド)チオフェン-3-カルボキシレート (1.87 g) を褐色オイルとして得た。¹H-NMR (500 MHz, acetone-d₆, δ ppm): 8.22 (d, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.02 (d, 1H), 6.41–6.38 (m, 2H), 4.92 (brs, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 3.64 (s, 3H).

(3) 上記(2)の方法で合成したメチル 4-(N-(2,4-ジメトキシベンジル)-1,1,1-トリフルオロメチルスルホンアミド)チオフェン-3-カルボキシレート (12.2 g) をTHF (100 ml) に溶解させ、窒素雰囲気下、水素化リチウムアルミニウム (2.42 g) を含む予め氷冷したTHF (50 ml) の懸濁液に30分間かけて滴下した。室温にて2時間攪拌後、氷冷下で水を加えて反応を停止させ、酢酸エチルと2 N塩酸水溶液とを加え、しばらく攪拌した。水層を酢酸エチルで抽出し、有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (ヘプタン：酢酸エチル=8：2～7：3) で精製してN-(2,4-ジメトキシベンジル)-1,1,1-トリフルオロ-N-(4-(ヒドロキシメチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド (9.00 g) を褐色オイルとして得た。¹H-NMR (500 MHz, acetone-d₆, δ ppm): 7.38 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.00 (d, 1H), 6.45 (d, 1H), 6.37 (dd, 1H), 4.87 (s, 2H), 4.32 (brs, 2H), 3.73 (s, 3H), 3.67 (s, 3H).

(4) 上記(3)で合成したN-(2,4-ジメトキシベンジル)-1,1,1-トリフルオ

ロ-N-(4-(ヒドロキシメチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド (9.00 g) をクロロホルム (90 ml) に溶解させ、四臭化炭素 (7.63 g) とトリフェニルホスフィン (6.32 g) とを室温に加えた。室温にて16時間攪拌後、水を加えた。分液した水層をクロロホルムで抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥して、溶媒を減圧下で留去した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (ヘプタン：酢酸エチル=8：2~7：3) で精製し、N-(4-(ブロモメチル)チオフェン-3-イル)-N-(2,4-ジメトキシベンジル)-1,1,1-トリフルオロメタンスルホンアミド (8.00 g) を黄色固体として得た。¹H-NMR (500 MHz, acetone-d₆, δ ppm) : 7.55 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.03 (d, 1H), 6.48 (d, 1H), 6.40 (dd, 1H), 4.93 (s, 2H), 4.29 (s, 2H), 3.75 (s, 3H), 3.70 (s, 3H).

(5) 2-ピペリドン (1.38 g) とヨウ化カリウム (0.18 g) とをDMF (70 ml) に溶解させ、そこに水素化ナトリウム (60 wt%, 0.61 g) を室温に加えた。この混合溶液を攪拌しながら、そこに上記(4)で合成したN-(4-(ブロモメチル)チオフェン-3-イル)-N-(2,4-ジメトキシベンジル)-1,1,1-トリフルオロメタンスルホンアミド (6.00 g) のDMF (30 ml) 溶液を5分間かけて滴下した。3時間攪拌後、水を加えて反応を停止し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を減圧下で留去した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (ヘプタン：酢酸エチル=7：3~6：4) で精製し、N-(2,4-ジメトキシベンジル)-1,1,1-トリフルオロ-N-(4-((2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド (4.06 g) を褐色オイルとして得た。¹H-NMR (500 MHz, acetone-d₆, δ ppm) : 7.54 (d, 1H), 7.03-7.01 (m, 2H), 6.48 (d, 1H), 6.40 (dd, 1H), 4.91 (brs, 2H), 4.45 (brs, 1H), 3.75 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 2.82 (m, 2H), 2.27 (t, 2H), 1.71 (m, 4H).

(6) 上記(5)で合成したN-(2,4-ジメトキシベンジル)-1,1,1-トリフルオロ-N-(4-((2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド (4.06 g) にトリエチルシラン (3.94 ml) とトリフルオロ酢酸

(82 ml) とを加え、室温で24時間攪拌した。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をカラムクロマトグラフィー（ヘプタン：酢酸エチル＝4：6～3：7）で精製し、目的物（3.23 g）を褐色オイルとして得た。

[0171] ・合成例2

エチル（4-((2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)((トリフルオロメチル)スルホニル)カーバメート（化合物No.1-3）の合成

前記合成例1で合成した1,1,1-トリフルオロ-N-(4-((2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド（2.00 g）をトルエン（60 ml）に溶解させ、ピリジン（0.71 ml）とクロロギ酸エチル（0.83 ml）とを加えて、室温で2時間攪拌した。0.1 N塩酸水溶液を加えて反応を停止した後、水層を酢酸エチルで抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を減圧下で留去した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィー（ヘプタン：酢酸エチル＝4：6～3：7）で精製し、目的物（1.48 g）を黄色固体として得た。

[0172] ・合成例3

1,1,1-トリフルオロ-N-(2-((4-メトキシ-2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド（化合物No.3-1）の合成

（1）窒素雰囲気下、3-アミノ-2-チオフェンカルボン酸メチル（50.2 g）、N,N-ジイソプロピルエチルアミン（68.0 ml）及びクロロホルム（1000 ml）の溶液を0℃に冷却し、攪拌しながらトリフルオロメタンスルホン酸無水物（112 g）を40分間かけて滴下した。室温まで昇温しながら、さらに90分間攪拌した後、反応溶液に水（500 ml）を加えた。水層をクロロホルムで抽出し、有機層を1つにまとめ、3 N塩酸水溶液と飽和食塩水で洗浄後、濃縮することで油状混合物（約110 g）を得た。この混合物にエタノール（100 ml）、水（500 ml）、及び水酸化ナトリウム（48 g）を加え、還流させながら30分間攪拌した。室温まで放冷後、氷浴で冷却しながら濃塩酸（120 ml）を加えた。懸濁液をさらに約1時間攪拌した後に固体を減圧濾過によって集めた。固体を水によって洗浄したのち、減圧下で乾燥することで3-(トリフルオ

ロメチルスルホンアミド)チオフェン-2-カルボン酸を薄い黄色固体 (67.9 g) で得た。¹H-NMR (500 MHz, CDCl₃, δ ppm): 7.39 (d, J=5.5 Hz, 1H), 7.60 (d, J=5.5 Hz, 1H), 9.94 (brs, 1H).

(2) 上記 (1) で合成した3-(トリフルオロメチルスルホンアミド)チオフェン-2-カルボン酸 (9.50 g) をTHF (100 ml) に溶解させ、窒素雰囲気下、水素化リチウムアルミニウム (4.27 g) を含む予め冷却したTHF (200 ml) の懸濁液に10分間かけて滴下した。還流下で45分間攪拌し、冷却後、氷冷下で水を加えて反応を停止した。酢酸エチルと2 N塩酸水溶液 (200 ml) とを加え、しばらく攪拌した。水層を酢酸エチルで抽出し、有機層を合わせて2 N塩酸水溶液 (200 ml) と飽和食塩水とで洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を減圧下で留去し、粗製の1,1,1-トリフルオロ-N-(2-(ヒドロキシメチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド (9.05 g) を得た。

(3) 上記 (2) で合成した粗製の1,1,1-トリフルオロ-N-(2-(ヒドロキシメチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド (3.41 g) を1,4-ジオキサン (56 ml) に溶解し、p-トルエンスルホン酸一水和物 (2.60 g) と4-ヒドロキシ-2-ピペリドン (1.58 g) とを加えた。反応溶液を加熱し、Dean-Stark装置を用いて共沸脱水しながら1時間攪拌した。室温まで冷却後、溶媒を留去した。残渣を酢酸エチルで希釈し、水と飽和食塩水とで洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (ヘプタン: 酢酸エチル=9:1~3:7) で精製し、1,1,1-トリフルオロ-N-(2-((4-ヒドロキシ-2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド (1.97 g) を薄い紫色固体として得た。¹H-NMR (500 MHz, acetone-d₆, δ ppm): 11.84 (brs, NH), 7.46 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 4.62 (d, 1H), 4.59 (d, 1H), 4.20 (brs, OH), 4.13-4.17 (m, 1H), 3.73 (ddd, 1H), 3.47-3.52 (m, 1H), 2.57-2.62 (m, 1H), 2.32 (ddd, 1H), 1.98-2.05 (m, 1H), 1.84-1.90 (m, 1H).

(4) 上記 (3) で合成した1,1,1-トリフルオロ-N-(2-((4-ヒドロキシ-2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド (

1.46 g) とトリエチルアミン (1.40 ml) とをクロロホルム (20 ml) に溶解させた後、窒素雰囲気下、氷浴で冷却した。そこにメタンスルホニルクロリド (0.40 ml) を加えて室温で攪拌した。3.25 時間後、2 N 塩酸水溶液を加えて反応を停止し、水層をクロロホルムで抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を減圧下で留去した。得られた混合物を THF (20 ml) に溶解させ、そこに 1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン (1.25 ml) を加えて室温で 22.5 時間攪拌した。さらに 1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン (0.60 ml) を追加した後、1 時間攪拌し、2 N 塩酸水溶液を加えて反応を停止した。酢酸エチルで抽出後、有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (ヘプタン : 酢酸エチル = 1 : 0 ~ 1 : 1) で精製し、1,1,1-トリフルオロ-N-(2-((2-オキソ-5,6-ジヒドロピリジン-1(2H)-イル)メチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド (1.32 g) を褐色固体として得た。¹H-NMR (500 MHz, acetone-d₆, δ ppm): 11.54 (br s, NH), 7.47 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 6.73-6.77 (m, 1H), 5.83-5.86 (m, 1H), 4.67 (s, 2H), 3.65-3.68 (m, 2H), 2.47-2.51 (m, 2H).

(5) 上記 (4) で合成した 1,1,1-トリフルオロ-N-(2-((2-オキソ-5,6-ジヒドロピリジン-1(2H)-イル)メチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド (0.51 g) をメタノール (5 ml) と THF (10 ml) との混合溶媒に溶解させ、そこに室温で水素化ナトリウム (60 wt%, 0.15 g) を加えた。そして還流下、反応混合物を 7 時間攪拌した。室温まで放冷後、2 N 塩酸水溶液で酸性化した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (ヘプタン : 酢酸エチル = 9 : 1 ~ 1 : 1) で精製し、目的物 (285 mg) を褐色オイルとして得た。

[0173] ・ 合成例 4

イソプロピル (2-((4-(メトキシメトキシ)-2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)((トリフルオロメチル)スルホニル)カルバメート (化

合物No. 3-73) の合成

(1) 前記合成例3の(3)で合成した1,1,1-トリフルオロ-N-(2-((4-ヒドロキシ-2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド (0.96 g) をトルエン (20 ml) に溶解し、ピリジン (0.65 ml) とクロロギ酸イソプロピル (0.77 ml) とを室温に加えた。40分間攪拌後、2 N塩酸水溶液を加えて反応を停止後、水層を酢酸エチルで抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧下で留去した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (ヘプタン: 酢酸エチル=1:0~0:1) で精製し、イソプロピル (2-((4-ヒドロキシ-2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)((トリフルオロメチル)スルホニル)カルバメート (753 mg) を褐色固体として得た。

(2) 上記(1)で合成したイソプロピル (2-((4-ヒドロキシ-2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)((トリフルオロメチル)スルホニル)カルバメート (150 mg) をクロロホルム (5 ml) に溶解し、氷冷下、ジイソプロピルエチルアミン (0.29 ml) とクロロメチルメチルエーテル (0.10 ml) とを加えた。窒素雰囲気下、室温で65時間攪拌した後、水を加えて反応を停止した。水層をクロロホルムで抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧下で留去した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (ヘプタン: 酢酸エチル=1:1) で精製し、目的物 (146 mg) を黄色オイルとして得た。

[0174] ・合成例5

1,1,1-トリフルオロ-N-(2-((3-メトキシ-2-チオキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド (化合物No. 3-345) の合成

3-メトキシピペリジン-2-オンを用いて、合成例3に記載の手順に準じて合成した1,1,1-トリフルオロ-N-(2-((3-メトキシ-2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド (0.7 g) を1,4-ジオキサン (15 ml) に溶解させ、ローソン試薬 (2.3 g) を加えて5時間還流した。溶媒を減圧下で留去した後、2 N水酸化ナトリウム水溶液を加え目的物を水層

に溶かした。水層をクロロホルムで洗浄し、1N塩酸水溶液にて酸性にした後、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄した後、硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を減圧下で留去した。得られた残渣をカラムクロマトグラフィー（ヘプタン：酢酸エチル＝4：6～3：7）で精製し、目的物（0.4 g）を褐色オイルとして得た。

[0175] ・合成例6

1,1,1-トリフルオロ-N-(4-((3-メトキシ-2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド（化合物No.1-183）の合成

（1）合成例1に記載の手順に準じて合成することで1,1,1-トリフルオロ-N-(4-メトキシベンジル)-N-(4-((2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミドを褐色オイルとして得た。

$^1\text{H-NMR}$ (500 MHz, acetone- d_6 , δ ppm): 7.68 (brd, 1H), 7.13-7.16 (m, 2H), 7.09 (brd, 1H), 6.87-6.89 (m, 2H), 3.77 (s, 3H), 3.40-5.20 (br, 4H), 2.74 (br, 2H), 2.25-2.27 (m, 2H), 1.65-1.76 (m, 4H).

（2）窒素雰囲気下、上記（1）で合成した1,1,1-トリフルオロ-N-(4-メトキシベンジル)-N-(4-((2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド（5.88 g）とトリエチルアミン（2.70 ml）をクロロホルム（80 ml）に溶解し、氷冷下、トリフルオロメタンスルホン酸トリメチルシリル（3.50 ml）を滴下した。氷冷しながら1時間攪拌後、そこにトリメチルフェニルアンモニウムトリブロミド（6.00 g）を少しずつ加えた。氷浴を取り除き、室温で18時間攪拌した後、水を加えて反応を停止した。水層を分離し、クロロホルムで抽出した。有機層を合わせ、飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥させ、溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をカラムクロマトグラフィー（ヘプタン：酢酸エチル＝9：1～4：6）で精製し、N-(4-((3-ブromo-2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)-1,1,1-トリフルオロ-N-(4-メトキシベンジル)メタンスルホンアミド（2.47 g）を褐色オイルとして得た。

$^1\text{H-NMR}$ (500 MHz, acetone- d_6 , δ ppm): 7.76 (brs, 1H), 7.14-7.17 (m, 2H)

), 7.11 (brs, 1H), 6.88-6.90 (m, 2H), 4.62 (dd, 1H), 3.78 (s, 3H), 3.50-5.30 (br, 4H), 2.50-3.10 (br, 2H), 2.29-2.38 (m, 1H), 2.13-2.19 (m, 1H), 2.02-2.12 (m, 1H), 1.68-1.76 (m, 1H).

(3) 上記(2)で合成したN-(4-((3-ブromo-2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)-1,1,1-トリフルオロ-N-(4-メトキシベンジル)メタンスルホンアミド (2.47 g) をTHF (30 ml) に溶解させ、そこに酢酸カリウム (0.77 g) と18-クラウン6-エーテル (0.10 g) を加えた後、反応溶液を加熱し、還流させながら2時間攪拌した。室温まで冷却後、反応溶液を減圧下で濃縮して反応溶媒を留去した。残渣にエタノール (50 ml) と2 N水酸化ナトリウム水溶液 (10 ml) を加え、60℃に加熱して1時間攪拌した。室温まで冷却後、反応溶液を2 N塩酸水溶液で酸性にし、減圧下で濃縮してエタノールを留去した。残渣を酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥させ、溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣 (2.44 g) をカラムクロマトグラフィー (ヘプタン：酢酸エチル=1：1～0：1) で精製し、1,1,1-トリフルオロ-N-(4-((3-ヒドロキシ-2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)-N-(4-メトキシベンジル)メタンスルホンアミド (1.66 g) を得た。

¹H-NMR (500 MHz, acetone-d₆, δ ppm): 7.74 (brd, 1H), 7.13-7.16 (m, 2H), 7.12 (brd, 1H), 6.87-6.90 (m, 2H), 4.00 (s, 0H), 3.97 (dd, 1H), 3.77 (s, 3H), 3.50-5.30 (br, 4H), 2.67-2.83 (m, 2H), 2.07-2.13 (m, 1H), 1.68-1.81 (m, 2H), 1.57-1.65 (m, 1H).

(4) 上記(3)で合成した1,1,1-トリフルオロ-N-(4-((3-ヒドロキシ-2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)-N-(4-メトキシベンジル)メタンスルホンアミド (0.986 g) をDMF (10 ml) に溶解させ、そこに水素化ナトリウム (60 wt%, 0.10 g) を室温に加えた。窒素雰囲気下、この混合溶液を攪拌しながら、ヨウ化メチル (0.25 ml) を加えた。その後、反応溶液を100℃に加熱し、1.5時間攪拌した。室温まで冷却後、2 N塩酸水溶液を加えて反応を停止し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、

硫酸ナトリウムで乾燥させて溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をカラムクロマトグラフィー（ヘプタン：酢酸エチル＝１：１）で精製し、1,1,1-トリフルオロ-N-(4-((3-メトキシ-2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)-N-(4-メトキシベンジル)メタンスルホンアミド（0.847 g）を黄色の油状物質として得た。

¹H-NMR (500 MHz, acetone-d₆, δ ppm): 7.71 (brs, 1H), 7.13-7.16 (m, 2H), 7.06 (brs, 1H), 6.87-6.90 (m, 2H), 3.77 (s, 3H), 3.61 (m, 1H), 3.45 (s, 3H), 3.20-5.30 (br, 4H), 2.72 (br, 2H), 1.89-1.95 (m, 1H), 1.76-1.85 (m, 2H), 1.57-1.64 (m, 1H).

（５）上記（４）で合成した1,1,1-トリフルオロ-N-(4-((3-メトキシ-2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)-N-(4-メトキシベンジル)メタンスルホンアミド（0.847 g）とトリエチルシラン（0.85 ml）、トリフルオロ酢酸（5 ml）を混合し、およそ95℃のオイルバスで加熱しながら15時間攪拌した。室温まで冷却後、反応溶液を減圧下で濃縮した。残渣をクロロホルムに溶解し、2 N水酸化ナトリウム水溶液で洗浄した。アルカリ性の水層を分離し、2 N塩酸水溶液で酸性にした後、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥させて溶媒を減圧下で留去し、目的物（0.522 g）を黄色の油状物質として得た。

[0176] ・ 合成例 7

1,1,1-トリフルオロ-N-(2-((5-メチルチオ2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)メタンスルホンアミド（化合物No. 3-320）の合成

（１）5-ヒドロキシピペリジン-2-オンを用い合成例 2 と合成例 3 に記載の方法に準じて合成することで、イソプロピル(2-((5-ヒドロキシ-2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)((トリフルオロメチル)スルホニル)カルバメートをピンク色の固体として得た。

融点: 114-119℃

¹H-NMR (500 MHz, acetone-d₆, δ ppm): 7.49 (d, 1H), 6.97 (d, 1H), 5.09 (sep, 1H), 4.40-5.00 (br, 2H), 4.19 (d, 0H), 4.10 (brm, 1H), 3.40-3.

4.8 (brm, 1H), 3.20 (dd, 1H), 2.52 (ddd, 1H), 2.30 (ddd, 1H), 1.92–1.98 (m, 1H), 1.80–1.87 (m, 1H), 1.30 (d, 6H).

(2) 上記(1)で合成したイソプロピル(2-((5-ヒドロキシ-2-オキソピペリジン-1-イル)メチル)チオフェン-3-イル)((トリフルオロメチル)スルホン)カルバメート(183 mg)をTHF(5 ml)に溶解させ、トリエチルアミン(0.12 ml)を加えて、窒素雰囲気下、攪拌しながら氷浴で冷却した。そこにメタンスルホンクロリド(0.06 ml)を加えて、85分間攪拌した。反応溶液に水を加えて反応を停止し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥させて溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をカラムクロマトグラフィー(ヘプタン：酢酸エチル=9：1から7：3)で精製し、6-オキソ-1-((3-((1,1,1-トリフルオロ-N-(イソプロポキシカルボニル)メチル)スルホンアミド)チオフェン-2-イル)メチル)ピペリジン-3-イルメタンスルホネート(206 mg)を白色固体として得た。

融点： 100–103.5 °C

¹H-NMR (500 MHz, acetone-d₆, δ ppm) : 7.52 (d, 1H), 6.99 (d, 1H), 5.16–5.19 (m, 1H), 5.09 (m, 1H), 4.50–5.00 (br, 2H), 3.65–3.76 (brm, 1H), 3.52–3.60 (brm, 1H), 3.13 (s, 3H), 2.56 (ddd, 1H), 2.44 (ddd, 1H), 2.16–2.25 (m, 2H), 1.30–1.31 (m, 6H).

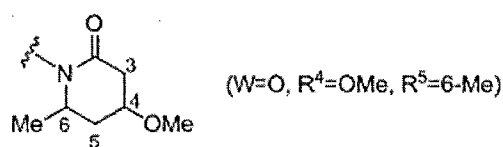
(3) 上記(2)の手順で合成した6-オキソ-1-((3-((1,1,1-トリフルオロ-N-(イソプロポキシカルボニル)メチル)スルホンアミド)チオフェン-2-イル)メチル)ピペリジン-3-イルメタンスルホネート(378 mg)をDMF(5 ml)に溶解させ、室温で攪拌しながら、ナトリウムチオメトキシド(134 mg、95 wt%)を加えた。室温で5時間攪拌後、反応溶液に希塩酸を加えて反応を停止し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥させて溶媒を減圧下で留去し、得られた残渣をカラムクロマトグラフィー(ヘプタン：酢酸エチル=9：1から7：3)で精製し、目的物(142 mg)を油状物質として得た。

[0177] 次に、本発明化合物の代表例を第1表から第3表に挙げる。これらの化合

物は、前記合成例或いは前記種々の製造方法に基づいて合成することができる。第1表から第3表中、物性欄に記載の数値は融点（℃）を表し、NMRと記載されている化合物はそれらの¹H-NMRスペクトルデータを第4表に挙げる。尚、第1表から第4表中、No. は化合物No. を示す。また、表中、Meはメチル基を、Etはエチル基を、n-Prはノルマルプロピル基を、i-Prはイソプロピル基を、n-Buはノルマルブチル基を、s-Buはセカンダリーブチル基を、i-Buはイソブチル基を、t-Buはターシャリーブチル基を、Phはフェニル基を示す。また、『3-CF₃Ph』は3位にCF₃が置換したフェニル基を表し、他の同様の記載もこれに準じる。

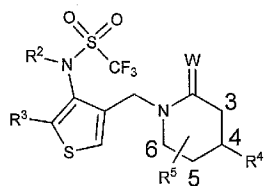
[0178] また、第1表から第3表中、一般式（I-1）から一般式（I-3）で、例えばR⁵が『6-Me』とは、下図の様にピペリジン環の6位にメチル基が置換していることを表し、他の同様の記載もこれに準じる。

[0179] [化21]



[0180]

[表1]



一般式 (I-1)

第 1 表

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
1-1	H	H	H	H	O	NMR
1-2	CO ₂ Me	H	H	H	O	
1-3	CO ₂ Et	H	H	H	O	NMR
1-4	CO ₂ n-Pr	H	H	H	O	
1-5	CO ₂ i-Pr	H	H	H	O	NMR
1-6	CO ₂ n-Bu	H	H	H	O	
1-7	CO ₂ i-Bu	H	H	H	O	NMR
1-8	CO ₂ t-Bu	H	H	H	O	
1-9	CO ₂ CH ₂ t-Bu	H	H	H	O	
1-10	H	H	H	H	S	
1-11	CO ₂ Me	H	H	H	S	
1-12	CO ₂ Et	H	H	H	S	
1-13	CO ₂ n-Pr	H	H	H	S	
1-14	CO ₂ i-Pr	H	H	H	S	
1-15	CO ₂ n-Bu	H	H	H	S	
1-16	CO ₂ i-Bu	H	H	H	S	
1-17	CO ₂ t-Bu	H	H	H	S	
1-18	H	H	Me	H	O	
1-19	CO ₂ Me	H	Me	H	O	
1-20	CO ₂ Et	H	Me	H	O	
1-21	CO ₂ n-Pr	H	Me	H	O	
1-22	CO ₂ i-Pr	H	Me	H	O	
1-23	CO ₂ n-Bu	H	Me	H	O	
1-24	CO ₂ i-Bu	H	Me	H	O	
1-25	CO ₂ t-Bu	H	Me	H	O	
1-26	H	H	Et	H	O	
1-27	CO ₂ Me	H	Et	H	O	
1-28	CO ₂ Et	H	Et	H	O	
1-29	CO ₂ n-Pr	H	Et	H	O	
1-30	CO ₂ i-Pr	H	Et	H	O	

[0181]

[表2]

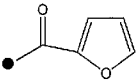
第1表のつづき

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
1-31	CO ₂ n-Bu	H	Et	H	0	
1-32	CO ₂ i-Bu	H	Et	H	0	
1-33	CO ₂ t-Bu	H	Et	H	0	
1-34	H	H	OH	H	0	
1-35	CO ₂ Me	H	OH	H	0	
1-36	CO ₂ Et	H	OH	H	0	
1-37	CO ₂ i-Pr	H	OH	H	0	
1-38	CO ₂ i-Bu	H	OH	H	0	
1-39	CO ₂ t-Bu	H	OH	H	0	
1-40	H	H	OMe	H	0	
1-41	CO ₂ Me	H	OMe	H	0	
1-42	CO ₂ Et	H	OMe	H	0	
1-43	CO ₂ n-Pr	H	OMe	H	0	
1-44	CO ₂ i-Pr	H	OMe	H	0	
1-45	CO ₂ n-Bu	H	OMe	H	0	
1-46	CO ₂ i-Bu	H	OMe	H	0	
1-47	CO ₂ t-Bu	H	OMe	H	0	
1-48	H	H	OEt	H	0	
1-49	CO ₂ Me	H	OEt	H	0	
1-50	CO ₂ Et	H	OEt	H	0	
1-51	CO ₂ n-Pr	H	OEt	H	0	
1-52	CO ₂ i-Pr	H	OEt	H	0	
1-53	CO ₂ n-Bu	H	OEt	H	0	
1-54	CO ₂ i-Bu	H	OEt	H	0	
1-55	CO ₂ t-Bu	H	OEt	H	0	
1-56	H	H	H	6-Me	0	NMR
1-57	CO ₂ Me	H	H	6-Me	0	
1-58	CO ₂ Et	H	H	6-Me	0	NMR
1-59	CO ₂ i-Pr	H	H	6-Me	0	
1-60	CO ₂ i-Bu	H	H	6-Me	0	

[0182]

[表3]

第1表のつづき

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
1-61	H	H	OMe	6-Me	0	
1-62	CO ₂ Me	H	OMe	6-Me	0	
1-63	CO ₂ Et	H	OMe	6-Me	0	
1-64	CO ₂ n-Pr	H	OMe	6-Me	0	
1-65	CO ₂ i-Pr	H	OMe	6-Me	0	
1-66	CO ₂ n-Bu	H	OMe	6-Me	0	
1-67	CO ₂ i-Bu	H	OMe	6-Me	0	
1-68	CO ₂ t-Bu	H	OMe	6-Me	0	
1-69	H	Me	H	H	0	169
1-70	CO ₂ Me	Me	H	H	0	
1-71	CO ₂ Et	Me	H	H	0	NMR
1-72	CO ₂ n-Pr	Me	H	H	0	
1-73	CO ₂ i-Pr	Me	H	H	0	NMR
1-74	CO ₂ n-Bu	Me	H	H	0	
1-75	CO ₂ i-Bu	Me	H	H	0	
1-76	CO ₂ t-Bu	Me	H	H	0	
1-77	CO ₂ n-C ₆ H ₁₃	Me	H	H	0	NMR
1-78		Me	H	H	0	NMR
1-79	H	Cl	H	H	0	142
1-80	CO ₂ Et	Cl	H	H	0	124
1-81	CO ₂ i-Pr	Cl	H	H	0	
1-82	CO ₂ i-Bu	Cl	H	H	0	
1-83	H	Br	H	H	0	
1-84	CO ₂ Et	Br	H	H	0	
1-85	CO ₂ i-Pr	Br	H	H	0	
1-86	CO ₂ i-Bu	Br	H	H	0	
1-87	H	I	H	H	0	75
1-88	CO ₂ Et	I	H	H	0	132
1-89	CO ₂ i-Pr	I	H	H	0	
1-90	CO ₂ i-Bu	I	H	H	0	

[0183]

[表4]

第1表のつづき

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
1-91	H	Me	Me	H	0	
1-92	CO ₂ Me	Me	Me	H	0	
1-93	CO ₂ Et	Me	Me	H	0	
1-94	CO ₂ n-Pr	Me	Me	H	0	
1-95	CO ₂ i-Pr	Me	Me	H	0	
1-96	CO ₂ n-Bu	Me	Me	H	0	
1-97	CO ₂ i-Bu	Me	Me	H	0	
1-98	CO ₂ t-Bu	Me	Me	H	0	
1-99	H	Me	H	6-Me	0	177-178
1-100	CO ₂ Me	Me	H	6-Me	0	
1-101	CO ₂ Et	Me	H	6-Me	0	
1-102	CO ₂ i-Pr	Me	H	6-Me	0	NMR
1-103	CO ₂ i-Bu	Me	H	6-Me	0	
1-104	H	Me	OMe	H	0	
1-105	CO ₂ Me	Me	OMe	H	0	
1-106	CO ₂ Et	Me	OMe	H	0	
1-107	CO ₂ n-Pr	Me	OMe	H	0	
1-108	CO ₂ i-Pr	Me	OMe	H	0	
1-109	CO ₂ n-Bu	Me	OMe	H	0	
1-110	CO ₂ i-Bu	Me	OMe	H	0	
1-111	CO ₂ t-Bu	Me	OMe	H	0	
1-112	H	H	H	5-Me	0	NMR
1-113	CO ₂ Et	H	H	5-Me	0	NMR
1-114	CO ₂ i-Pr	H	H	5-Me	0	NMR
1-115	CO ₂ i-Bu	H	H	5-Me	0	
1-116	H	H	OMe	5-Me	0	
1-117	CO ₂ Et	H	OMe	5-Me	0	
1-118	CO ₂ i-Pr	H	OMe	5-Me	0	
1-119	CO ₂ n-Bu	H	OMe	5-Me	0	
1-120	CO ₂ i-Bu	H	OMe	5-Me	0	

[0184]

[表5]

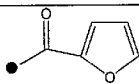
第1表のつづき

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
1-121	H	Me	H	5-Me	0	112-113
1-122	CO ₂ Me	Me	H	5-Me	0	
1-123	CO ₂ Et	Me	H	5-Me	0	
1-124	CO ₂ i-Pr	Me	H	5-Me	0	NMR
1-125	CO ₂ i-Bu	Me	H	5-Me	0	
1-126	H	H	H	3-Me	0	NMR
1-127	CO ₂ Me	H	H	3-Me	0	
1-128	CO ₂ Et	H	H	3-Me	0	
1-129	CO ₂ n-Pr	H	H	3-Me	0	
1-130	CO ₂ i-Pr	H	H	3-Me	0	NMR
1-131	CO ₂ n-Bu	H	H	3-Me	0	
1-132	CO ₂ i-Bu	H	H	3-Me	0	
1-133	CO ₂ t-Bu	H	H	3-Me	0	
1-134	H	H	OMe	3-Me	0	
1-135	CO ₂ Me	H	OMe	3-Me	0	
1-136	CO ₂ Et	H	OMe	3-Me	0	
1-137	CO ₂ i-Pr	H	OMe	3-Me	0	
1-138	CO ₂ i-Bu	H	OMe	3-Me	0	
1-139	H	Me	H	3-Me	0	
1-140	CO ₂ Me	Me	H	3-Me	0	
1-141	CO ₂ Et	Me	H	3-Me	0	
1-142	CO ₂ n-Pr	Me	H	3-Me	0	
1-143	CO ₂ i-Pr	Me	H	3-Me	0	
1-144	CO ₂ n-Bu	Me	H	3-Me	0	
1-145	CO ₂ i-Bu	Me	H	3-Me	0	
1-146	CO ₂ t-Bu	Me	H	3-Me	0	
1-147	CO(SMe)	H	H	H	0	156.5-158.5
1-148	CO(SEt)	H	H	H	0	
1-149	CO(SiPr)	H	H	H	0	
1-150	CH ₂ OCOt-Bu	H	H	H	0	

[0185]

[表6]

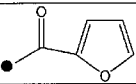
第1表のつづき

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
1-151	CH ₂ OCOn-Pr	H	H	H	0	
1-152	CH ₂ OCOPh	H	H	H	0	
1-153	CH(CH ₃)OCOMe	H	H	H	0	
1-154	CH(CH ₃)OCOEt	H	H	H	0	
1-155	CH ₂ OCO ₂ Me	H	H	H	0	
1-156	CH ₂ OCO ₂ Et	H	H	H	0	
1-157	CH ₂ Ph	H	H	H	0	
1-158	COMe	H	H	H	0	
1-159	COEt	H	H	H	0	
1-160		H	H	H	0	NMR
1-161	CH ₂ OCOMe	H	H	H	0	
1-162	CH ₂ OCOEt	H	H	H	0	
1-163	CH ₂ OCOt-Bu	H	H	H	0	NMR
1-164	CH ₂ OCOn-Pr	H	H	H	0	
1-165	CH ₂ OCOPh	H	H	H	0	
1-166	CH(CH ₃)OCOMe	H	H	H	0	
1-167	CH(CH ₃)OCOEt	H	H	H	0	
1-168	CH ₂ OCO ₂ Me	H	H	H	0	
1-169	CH ₂ OCO ₂ Et	H	H	H	0	NMR
1-170	SO ₂ CF ₃	H	H	H	0	
1-171	SO ₂ Ph	H	H	H	0	136
1-172	CO ₂ C(CH ₃) ₂ CCl ₃	H	H	H	0	153-156
1-173	CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	H	0	NMR
1-174	CO(SMe)	Me	H	H	0	
1-175	CO(SEt)	Me	H	H	0	
1-176	CO(SiPr)	Me	H	H	0	76-78
1-177	H	H	H	3-Br	0	
1-178	CO ₂ i-Pr	H	H	3-Br	0	NMR
1-179	CO(SiPr)	H	H	3-Br	0	
1-180	H	H	H	3-OH	0	NMR

[0186]

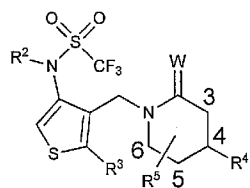
[表7]

第1表のつづき

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
1-181	CO ₂ i-Pr	H	H	3-OH	0	NMR
1-182	CO(SiPr)	H	H	3-OH	0	
1-183	H	H	H	3-OMe	0	NMR
1-184	CO ₂ i-Pr	H	H	3-OMe	0	NMR
1-185	CO(SiPr)	H	H	3-OMe	0	NMR
1-186	CO(SEt)	H	H	3-OMe	0	NMR
1-187	H	H	H	3-OCOCH ₃	0	
1-188	CO ₂ i-Pr	H	H	3-OCOCH ₃	0	NMR
1-189	CO(SiPr)	H	H	3-OCOCH ₃	0	
1-190	COCH ₃	H	H	3-OCOCH ₃	0	
1-191	p-methoxybenzyl	Me	H	3-OMe	0	NMR
1-192	H	Me	H	3-OMe	0	129-131
1-193	CO ₂ Me	Me	H	3-OMe	0	
1-194	CO ₂ Et	Me	H	3-OMe	0	
1-195	CO ₂ i-Pr	Me	H	3-OMe	0	NMR
1-196	CO(SMe)	Me	H	3-OMe	0	
1-197	CO(SEt)	Me	H	3-OMe	0	
1-198	CO(SiPr)	Me	H	3-OMe	0	NMR
1-199	H	Me	H	3-OMe	S	
1-200	CO ₂ i-Pr	Me	H	3-OMe	S	
1-201	CO(SiPr)	Me	H	3-OMe	S	
1-202		H	H	3-OMe	0	
1-203	CH(CH ₃)OCOMe	H	H	3-OMe	0	
1-204	CH(CH ₃)OCOEt	H	H	3-OMe	0	
1-205	SO ₂ Ph	H	H	3-OMe	0	
1-206	CO ₂ C(CH ₃) ₂ CCl ₃	H	H	3-OMe	0	
1-207	CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	3-OMe	0	
1-208	CO(SnPr)	H	H	3-OMe	0	NMR
1-209	CO ₂ i-Pr	H	H	3-F	0	NMR
1-210	CO(SiPr)	H	H	3-Me	0	NMR
1-211	CO(SiPr)	Me	H	3-Me	0	NMR
1-212	CO(SiBu)	H	H	3-OMe	0	NMR
1-213	CO(StBu)	H	H	3-OMe	0	NMR
1-214	CO ₂ (CH ₂) ₅ CH ₃	H	H	3-OMe	0	NMR

[0187]

[表8]



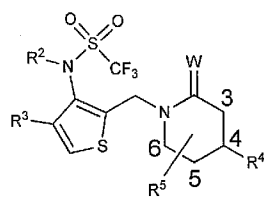
一般式 (I-2)

第2表

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
2-1	H	Me	H	H	0	NMR
2-2	CO ₂ Me	Me	H	H	0	
2-3	CO ₂ Et	Me	H	H	0	NMR
2-4	CO ₂ n-Pr	Me	H	H	0	
2-5	CO ₂ i-Pr	Me	H	H	0	NMR
2-6	CO ₂ n-Bu	Me	H	H	0	
2-7	CO ₂ i-Bu	Me	H	H	0	NMR
2-8	CO ₂ C(CH ₃) ₂ CCl ₃	Me	H	H	0	136-142
2-9	CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Me	H	H	0	NMR
2-10		Me	H	H	0	NMR
2-11	H	Me	Me	H	0	
2-12	CO ₂ Me	Me	Me	H	0	
2-13	CO ₂ Et	Me	Me	H	0	
2-14	CO ₂ n-Pr	Me	Me	H	0	
2-15	CO ₂ i-Pr	Me	Me	H	0	
2-16	CO ₂ n-Bu	Me	Me	H	0	
2-17	CO ₂ i-Bu	Me	Me	H	0	
2-18	CO ₂ t-Bu	Me	Me	H	0	
2-19	H	Me	H	6-Me	0	
2-20	CO ₂ Et	Me	H	6-Me	0	
2-21	CO ₂ i-Pr	Me	H	6-Me	0	
2-22	CO ₂ i-Bu	Me	H	6-Me	0	
2-23	H	Me	H	5-Me	0	
2-24	CO ₂ Et	Me	H	5-Me	0	
2-25	CO ₂ i-Pr	Me	H	5-Me	0	
2-26	CO ₂ i-Bu	Me	H	5-Me	0	
2-27	H	Me	H	3-Me	0	
2-28	CO ₂ Et	Me	H	3-Me	0	
2-29	CO ₂ i-Pr	Me	H	3-Me	0	
2-30	CO ₂ i-Bu	Me	H	3-Me	0	

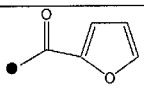
[0188]

[表9]



一般式 (I-3)

第3表

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
3-1	H	H	OMe	H	0	NMR
3-2	CO ₂ Me	H	OMe	H	0	
3-3	CO ₂ Et	H	OMe	H	0	NMR
3-4	CO ₂ i-Pr	H	OMe	H	0	64-70
3-5	CO ₂ i-Bu	H	OMe	H	0	
3-6	CO ₂ s-Bu	H	OMe	H	0	NMR
3-7	CO ₂ t-Bu	H	OMe	H	0	
3-8	CO ₂ n-Bu	H	OMe	H	0	
3-9	CO ₂ n-C ₆ H ₁₃	H	OMe	H	0	
3-10	CO(SMe)	H	OMe	H	0	
3-11	CO(SEt)	H	OMe	H	0	
3-12	CO(SiPr)	H	OMe	H	0	NMR
3-13	CO(SiBu)	H	OMe	H	0	
3-14		H	OMe	H	0	NMR
3-15	H	Me	OMe	H	0	
3-16	CO ₂ Et	Me	OMe	H	0	
3-17	CO ₂ i-Pr	Me	OMe	H	0	
3-18	CO ₂ i-Bu	Me	OMe	H	0	
3-19	CO(SMe)	Me	OMe	H	0	
3-20	CO(SEt)	Me	OMe	H	0	
3-21	CO(SiPr)	Me	OMe	H	0	
3-22	H	H	OEt	H	0	
3-23	CO ₂ Me	H	OEt	H	0	
3-24	CO ₂ Et	H	OEt	H	0	
3-25	CO ₂ i-Pr	H	OEt	H	0	NMR

[0189]

[表10]

第3表のつづき

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
3-26	CO ₂ i-Bu	H	OE _t	H	0	
3-27	CO ₂ t-Bu	H	OE _t	H	0	
3-28	CO(SMe)	H	OE _t	H	0	
3-29	CO(SE _t)	H	OE _t	H	0	
3-30	CO(SiPr)	H	OE _t	H	0	
3-31	H	H	Oi-Pr	H	0	
3-32	CO ₂ Me	H	Oi-Pr	H	0	
3-33	CO ₂ Et	H	Oi-Pr	H	0	
3-34	CO ₂ i-Pr	H	Oi-Pr	H	0	
3-35	CO ₂ i-Bu	H	Oi-Pr	H	0	
3-36	CO(SMe)	H	Oi-Pr	H	0	
3-37	CO(SE _t)	H	Oi-Pr	H	0	
3-38	CO(SiPr)	H	Oi-Pr	H	0	
3-39	H	H	SMe	H	0	
3-40	CO ₂ Et	H	SMe	H	0	
3-41	CO ₂ i-Pr	H	SMe	H	0	90-92
3-42	CO(SiPr)	H	SMe	H	0	
3-43	H	H	OMe	4-Me	0	
3-44	CO ₂ Me	H	OMe	4-Me	0	
3-45	CO ₂ Et	H	OMe	4-Me	0	
3-46	CO ₂ i-Pr	H	OMe	4-Me	0	
3-47	CO ₂ i-Bu	H	OMe	4-Me	0	
3-48	CO(SMe)	H	OMe	4-Me	0	
3-49	CO(SE _t)	H	OMe	4-Me	0	
3-50	CO(SiPr)	H	OMe	4-Me	0	
3-51	CH ₂ OCOt-Bu	H	OMe	H	0	
3-52	CH ₂ OCOn-Pr	H	OMe	H	0	
3-53	CH ₂ OCOPh	H	OMe	H	0	
3-54	CH(CH ₃)OCOMe	H	OMe	H	0	
3-55	CH(CH ₃)OCOEt	H	OMe	H	0	

[0190]

[表11]

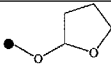
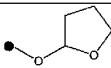
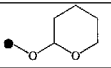
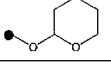
第3表のつづき

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
3-56	CH ₂ OCO ₂ Me	H	OMe	H	0	
3-57	CH ₂ OCO ₂ Et	H	OMe	H	0	
3-58	CH ₂ Ph	H	OMe	H	0	
3-59	COMe	H	OMe	H	0	
3-60	COEt	H	OMe	H	0	
3-61	CH ₂ OCOMe	H	OMe	H	0	
3-62	CH ₂ OCOEt	H	OMe	H	0	
3-63	CH ₂ OCOt-Bu	H	OMe	H	0	
3-64	CH ₂ OCOn-Pr	H	OMe	H	0	
3-65	CH ₂ OCOPh	H	OMe	H	0	
3-66	CH(CH ₃)OCOMe	H	OMe	H	0	
3-67	CH(CH ₃)OCOEt	H	OMe	H	0	
3-68	CH ₂ OCO ₂ Me	H	OMe	H	0	
3-69	CH ₂ OCO ₂ Et	H	OMe	H	0	
3-70	H	H	OCH ₂ OCH ₃	H	0	
3-71	CO ₂ Me	H	OCH ₂ OCH ₃	H	0	
3-72	CO ₂ Et	H	OCH ₂ OCH ₃	H	0	
3-73	CO ₂ i-Pr	H	OCH ₂ OCH ₃	H	0	NMR
3-74	CO ₂ i-Bu	H	OCH ₂ OCH ₃	H	0	
3-75	CO(SMe)	H	OCH ₂ OCH ₃	H	0	
3-76	CO(SEt)	H	OCH ₂ OCH ₃	H	0	
3-77	CO(SiPr)	H	OCH ₂ OCH ₃	H	0	
3-78	H	H	OCH ₂ SCH ₃	H	0	
3-79	CO ₂ Me	H	OCH ₂ SCH ₃	H	0	
3-80	CO ₂ Et	H	OCH ₂ SCH ₃	H	0	
3-81	CO ₂ i-Pr	H	OCH ₂ SCH ₃	H	0	
3-82	CO ₂ i-Bu	H	OCH ₂ SCH ₃	H	0	
3-83	CO(SMe)	H	OCH ₂ SCH ₃	H	0	
3-84	CO(SEt)	H	OCH ₂ SCH ₃	H	0	
3-85	CO(SiPr)	H	OCH ₂ SCH ₃	H	0	

[0191]

[表12]

第3表のつづき

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
3-86	H	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	0	
3-87	CO ₂ Me	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	0	
3-88	CO ₂ Et	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	0	
3-89	CO ₂ i-Pr	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	0	NMR
3-90	CO ₂ i-Bu	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	0	
3-91	CO(SMe)	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	0	
3-92	CO(SET)	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	0	
3-93	CO(S <i>i</i> Pr)	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	0	
3-94	H	H	OCH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	0	
3-95	CO ₂ Me	H	OCH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	0	
3-96	CO ₂ Et	H	OCH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	0	
3-97	CO ₂ i-Pr	H	OCH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	0	
3-98	CO ₂ i-Bu	H	OCH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	0	
3-99	CO(SMe)	H	OCH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	0	
3-100	CO(SET)	H	OCH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	0	
3-101	CO(S <i>i</i> Pr)	H	OCH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	0	
3-102	H	H		H	0	
3-103	CO ₂ i-Pr	H		H	0	
3-104	H	H		H	0	
3-105	CO ₂ i-Pr	H		H	0	NMR
3-106	H	H	OCH ₂ CH ₂ CN	H	0	
3-107	CO ₂ Me	H	OCH ₂ CH ₂ CN	H	0	
3-108	CO ₂ Et	H	OCH ₂ CH ₂ CN	H	0	
3-109	CO ₂ i-Pr	H	OCH ₂ CH ₂ CN	H	0	
3-110	CO ₂ i-Bu	H	OCH ₂ CH ₂ CN	H	0	

[0192]

[表13]

第3表のつづき

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
3-111	CO(SMe)	H	OCH ₂ CH ₂ CN	H	0	
3-112	CO(SEt)	H	OCH ₂ CH ₂ CN	H	0	
3-113	CO(SiPr)	H	OCH ₂ CH ₂ CN	H	0	
3-114	H	H	OCH ₂ CH ₂ NO ₂	H	0	
3-115	CO ₂ Me	H	OCH ₂ CH ₂ NO ₂	H	0	
3-116	CO ₂ Et	H	OCH ₂ CH ₂ NO ₂	H	0	
3-117	CO ₂ i-Pr	H	OCH ₂ CH ₂ NO ₂	H	0	
3-118	CO ₂ i-Bu	H	OCH ₂ CH ₂ NO ₂	H	0	
3-119	CO(SMe)	H	OCH ₂ CH ₂ NO ₂	H	0	
3-120	CO(SEt)	H	OCH ₂ CH ₂ NO ₂	H	0	
3-121	CO(SiPr)	H	OCH ₂ CH ₂ NO ₂	H	0	
3-122	H	H	OCH ₂ OCH ₂ Ph	H	0	
3-123	CO ₂ Me	H	OCH ₂ OCH ₂ Ph	H	0	
3-124	CO ₂ Et	H	OCH ₂ OCH ₂ Ph	H	0	
3-125	CO ₂ i-Pr	H	OCH ₂ OCH ₂ Ph	H	0	
3-126	CO ₂ i-Bu	H	OCH ₂ OCH ₂ Ph	H	0	
3-127	CO(SMe)	H	OCH ₂ OCH ₂ Ph	H	0	
3-128	CO(SEt)	H	OCH ₂ OCH ₂ Ph	H	0	
3-129	CO(SiPr)	H	OCH ₂ OCH ₂ Ph	H	0	
3-130	H	H	OPh	H	0	
3-131	CO ₂ Et	H	OPh	H	0	
3-132	CO ₂ i-Pr	H	OPh	H	0	
3-133	CO(SMe)	H	OPh	H	0	
3-134	CO(SiPr)	H	OPh	H	0	
3-135	H	H	O(3-CF ₃ -Ph)	H	0	
3-136	CO ₂ Et	H	O(3-CF ₃ -Ph)	H	0	
3-137	CO ₂ i-Pr	H	O(3-CF ₃ -Ph)	H	0	
3-138	CO(SMe)	H	O(3-CF ₃ -Ph)	H	0	
3-139	CO(SiPr)	H	O(3-CF ₃ -Ph)	H	0	
3-140	H	H	OCH ₂ CF ₃	H	0	

[0193]

[表14]

第3表のつづき

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
3-141	CO ₂ Me	H	OCH ₂ CF ₃	H	0	
3-142	CO ₂ Et	H	OCH ₂ CF ₃	H	0	
3-143	CO ₂ i-Pr	H	OCH ₂ CF ₃	H	0	
3-144	CO ₂ i-Bu	H	OCH ₂ CF ₃	H	0	
3-145	CO(SMe)	H	OCH ₂ CF ₃	H	0	
3-146	CO(SEt)	H	OCH ₂ CF ₃	H	0	
3-147	CO(SiPr)	H	OCH ₂ CF ₃	H	0	
3-148	H	H	OCH ₂ CHF ₂	H	0	
3-149	CO ₂ Me	H	OCH ₂ CHF ₂	H	0	
3-150	CO ₂ Et	H	OCH ₂ CHF ₂	H	0	
3-151	CO ₂ i-Pr	H	OCH ₂ CHF ₂	H	0	
3-152	CO ₂ i-Bu	H	OCH ₂ CHF ₂	H	0	
3-153	CO(SMe)	H	OCH ₂ CHF ₂	H	0	
3-154	CO(SEt)	H	OCH ₂ CHF ₂	H	0	
3-155	CO(SiPr)	H	OCH ₂ CHF ₂	H	0	
3-156	H	H	OCH ₂ CCH	H	0	
3-157	CO ₂ Me	H	OCH ₂ CCH	H	0	
3-158	CO ₂ Et	H	OCH ₂ CCH	H	0	
3-159	CO ₂ i-Pr	H	OCH ₂ CCH	H	0	
3-160	CO ₂ i-Bu	H	OCH ₂ CCH	H	0	
3-161	CO(SMe)	H	OCH ₂ CCH	H	0	
3-162	CO(SEt)	H	OCH ₂ CCH	H	0	
3-163	CO(SiPr)	H	OCH ₂ CCH	H	0	
3-164	H	H	OCH ₂ CHCH ₂	H	0	
3-165	CO ₂ Me	H	OCH ₂ CHCH ₂	H	0	
3-166	CO ₂ Et	H	OCH ₂ CHCH ₂	H	0	
3-167	CO ₂ i-Pr	H	OCH ₂ CHCH ₂	H	0	
3-168	CO ₂ i-Bu	H	OCH ₂ CHCH ₂	H	0	
3-169	CO(SMe)	H	OCH ₂ CHCH ₂	H	0	
3-170	CO(SEt)	H	OCH ₂ CHCH ₂	H	0	

[0194]

[表15]

第3表のつづき

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
3-171	CO(S <i>i</i> Pr)	H	OCH ₂ CHCH ₂	H	0	
3-172	H	H	OCH ₂ CH ₂ OH	H	0	
3-173	CO ₂ Me	H	OCH ₂ CH ₂ OH	H	0	
3-174	CO ₂ Et	H	OCH ₂ CH ₂ OH	H	0	
3-175	CO ₂ <i>i</i> -Pr	H	OCH ₂ CH ₂ OH	H	0	
3-176	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	OCH ₂ CH ₂ OH	H	0	
3-177	CO(SMe)	H	OCH ₂ CH ₂ OH	H	0	
3-178	CO(SEt)	H	OCH ₂ CH ₂ OH	H	0	
3-179	CO(S <i>i</i> Pr)	H	OCH ₂ CH ₂ OH	H	0	
3-180	H	H	OMe	H	S	
3-181	CO ₂ Et	H	OMe	H	S	
3-182	CO ₂ <i>i</i> -Pr	H	OMe	H	S	
3-183	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	OMe	H	S	
3-184	CO(SMe)	H	OMe	H	S	
3-185	CO(SEt)	H	OMe	H	S	
3-186	CO(S <i>i</i> Pr)	H	OMe	H	S	
3-187	H	H	H	6-OMe	0	
3-188	CO ₂ Et	H	H	6-OMe	0	
3-189	CO ₂ <i>i</i> -Pr	H	H	6-OMe	0	
3-190	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	6-OMe	0	
3-191	H	H	H	6-OEt	0	
3-192	CO ₂ Et	H	H	6-OEt	0	
3-193	CO ₂ <i>i</i> -Pr	H	H	6-OEt	0	
3-194	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	6-OEt	0	
3-195	H	H	OMe	6-Me	0	
3-196	CO ₂ Me	H	OMe	6-Me	0	
3-197	CO ₂ Et	H	OMe	6-Me	0	
3-198	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	OMe	6-Me	0	
3-199	CO ₂ <i>i</i> -Pr	H	OMe	6-Me	0	NMR
3-200	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	OMe	6-Me	0	

[0195]

[表16]

第3表のつづき

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
3-201	CO ₂ i-Bu	H	OMe	6-Me	0	
3-202	CO ₂ t-Bu	H	OMe	6-Me	0	
3-203	H	H	OEt	6-Me	0	
3-204	CO ₂ Me	H	OEt	6-Me	0	
3-205	CO ₂ Et	H	OEt	6-Me	0	
3-206	CO ₂ n-Pr	H	OEt	6-Me	0	
3-207-1	CO ₂ i-Pr	H	OEt	6-Me	0	NMR
3-207-2 (3-207-1の ジアステレオ異性体)	CO ₂ i-Pr	H	OEt	6-Me	0	NMR
3-208	CO ₂ n-Bu	H	OEt	6-Me	0	
3-209	CO ₂ i-Bu	H	OEt	6-Me	0	
3-210	CO ₂ t-Bu	H	OEt	6-Me	0	
3-211	H	H	H	5-OMe	0	
3-212	CO ₂ Et	H	H	5-OMe	0	
3-213	CO ₂ i-Pr	H	H	5-OMe	0	
3-214	CO ₂ i-Bu	H	H	5-OMe	0	
3-215	H	H	H	5-OEt	0	
3-216	CO ₂ Et	H	H	5-OEt	0	
3-217	CO ₂ i-Pr	H	H	5-OEt	0	
3-218	CO ₂ i-Bu	H	H	5-OEt	0	
3-219	H	H	OMe	5-Me	0	
3-220	CO ₂ Me	H	OMe	5-Me	0	
3-221	CO ₂ Et	H	OMe	5-Me	0	
3-222	CO ₂ n-Pr	H	OMe	5-Me	0	
3-223	CO ₂ i-Pr	H	OMe	5-Me	0	
3-224	CO ₂ n-Bu	H	OMe	5-Me	0	
3-225	CO ₂ i-Bu	H	OMe	5-Me	0	
3-226	CO ₂ t-Bu	H	OMe	5-Me	0	
3-227	H	H	OEt	5-Me	0	
3-228	CO ₂ Me	H	OEt	5-Me	0	
3-229	CO ₂ Et	H	OEt	5-Me	0	
3-230	CO ₂ n-Pr	H	OEt	5-Me	0	

[0196]

[表17]

第3表のつづき

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
3-231	CO ₂ i-Pr	H	OEt	5-Me	0	
3-232	CO ₂ n-Bu	H	OEt	5-Me	0	
3-233	CO ₂ i-Bu	H	OEt	5-Me	0	
3-234	CO ₂ t-Bu	H	OEt	5-Me	0	
3-235	H	H	H	3-OMe	0	NMR
3-236	CO ₂ Et	H	H	3-OMe	0	NMR
3-237	CO ₂ i-Pr	H	H	3-OMe	0	NMR
3-238	CO ₂ i-Bu	H	H	3-OMe	0	
3-239	H	H	H	3-OEt	0	
3-240	CO ₂ Et	H	H	3-OEt	0	
3-241	CO ₂ i-Pr	H	H	3-OEt	0	NMR
3-242	CO ₂ i-Bu	H	H	3-OEt	0	
3-243	H	H	OMe	3-Me	0	
3-244	CO ₂ Me	H	OMe	3-Me	0	
3-245	CO ₂ Et	H	OMe	3-Me	0	
3-246	CO ₂ n-Pr	H	OMe	3-Me	0	
3-247	CO ₂ i-Pr	H	OMe	3-Me	0	
3-248	CO ₂ n-Bu	H	OMe	3-Me	0	
3-249	CO ₂ i-Bu	H	OMe	3-Me	0	
3-250	CO ₂ t-Bu	H	OMe	3-Me	0	
3-251	H	H	OEt	3-Me	0	
3-252	CO ₂ Me	H	OEt	3-Me	0	
3-253	CO ₂ Et	H	OEt	3-Me	0	
3-254	CO ₂ n-Pr	H	OEt	3-Me	0	
3-255	CO ₂ i-Pr	H	OEt	3-Me	0	
3-256	CO ₂ n-Bu	H	OEt	3-Me	0	
3-257	CO ₂ i-Bu	H	OEt	3-Me	0	
3-258	CO ₂ t-Bu	H	OEt	3-Me	0	
3-259	CO(SMe)	H	OMe	6-Me	0	NMR
3-260	CO(SEt)	H	OMe	6-Me	0	

[0197]

[表18]

第3表のつづき

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
3-261	CO(SiPr)	H	OMe	6-Me	0	
3-262	CO(SMe)	H	OEt	6-Me	0	
3-263	CO(SEt)	H	OEt	6-Me	0	
3-264	CO(SiPr)	H	OEt	6-Me	0	
3-265	CO(SMe)	H	OMe	5-Me	0	
3-266	CO(SEt)	H	OMe	5-Me	0	
3-267	CO(SiPr)	H	OMe	5-Me	0	
3-268	CO(SMe)	H	OEt	5-Me	0	
3-269	CO(SEt)	H	OEt	5-Me	0	
3-270	CO(SiPr)	H	OEt	5-Me	0	
3-271	CO(SMe)	H	OMe	3-Me	0	
3-272	CO(SEt)	H	OMe	3-Me	0	
3-273	CO(SiPr)	H	OMe	3-Me	0	
3-274	CO(SMe)	H	OEt	3-Me	0	
3-275	CO(SEt)	H	OEt	3-Me	0	
3-276	CO(SiPr)	H	OEt	3-Me	0	
3-277	H	H	OCH ₂ OCH ₂ CH ₂ Cl	H	0	
3-278	CO ₂ i-Pr	H	OCH ₂ OCH ₂ CH ₂ Cl	H	0	NMR
3-279	CO(SiPr)	H	OCH ₂ OCH ₂ CH ₂ Cl	H	0	
3-280	H	H	OCH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	0	
3-281	CO ₂ i-Pr	H	OCH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	0	NMR
3-282	CO(SiPr)	H	OCH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	0	
3-283	H	H	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	0	
3-284	CO ₂ i-Pr	H	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	0	NMR
3-285	CO(SiPr)	H	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	0	
3-286	CO(SMe)	H	H	3-OMe	0	NMR
3-287	CO(SEt)	H	H	3-OMe	0	NMR
3-288	CO(SiPr)	H	H	3-OMe	0	NMR
3-289	CO(SiBu)	H	H	3-OMe	0	NMR
3-290	SO ₂ Ph	H	H	3-OMe	0	NMR

[0198]

[表19]

第3表のつづき

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
3-291	CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	3-OMe	O	NMR
3-292	CO ₂ C ₆ H ₁₃	H	H	3-OMe	O	NMR
3-293	H	H	H	3-OnPr	O	NMR
3-294	CO ₂ i-Pr	H	H	3-OnPr	O	NMR
3-295	CO(SiPr)	H	H	3-OnPr	O	NMR
3-296	H	H	H	3-OnBu	O	NMR
3-297	CO ₂ i-Pr	H	H	3-OnBu	O	NMR
3-298	CO(SiPr)	H	H	3-OnBu	O	
3-299	H	H	H	3-OCH ₂ CF ₃	O	NMR
3-300	CO ₂ i-Pr	H	H	3-OCH ₂ CF ₃	O	NMR
3-301	CO(SiPr)	H	H	3-OCH ₂ CF ₃	O	NMR
3-302	H	H	H	3-SMe	O	NMR
3-303	CO ₂ Et	H	H	3-SMe	O	
3-304	CO ₂ i-Pr	H	H	3-SMe	O	NMR
3-305	CO ₂ i-Bu	H	H	3-SMe	O	NMR
3-306	CO(SMe)	H	H	3-SMe	O	NMR
3-307	CO(SET)	H	H	3-SMe	O	109-112
3-308	CO(SiPr)	H	H	3-SMe	O	NMR
3-309	CO ₂ i-Bu	H	H	3-SOMe	O	NMR
3-310	CO ₂ i-Bu	H	H	3-SO ₂ Me	O	NMR
3-311	H	H	H	3-SEt	O	NMR
3-312	CO ₂ i-Pr	H	H	3-SEt	O	NMR
3-313	CO(SiPr)	H	H	3-SEt	O	
3-314	H	H	H	3-SCH ₂ CHF ₂	O	NMR
3-315	CO ₂ i-Pr	H	H	3-SCH ₂ CHF ₂	O	NMR
3-316	CO(SiPr)	H	H	3-SCH ₂ CHF ₂	O	NMR
3-317	H	H	H	5-OMe	S	
3-318	CO ₂ i-Pr	H	H	5-OMe	S	
3-319	CO(SiPr)	H	H	5-OMe	S	
3-320	H	H	H	5-SMe	O	NMR

[0199]

[表20]

第3表のつづき

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
3-321	CO ₂ i-Pr	H	H	5-SMe	O	64-66
3-322	CO(SiPr)	H	H	5-SMe	O	103-105
3-323	H	H	SMe	6-Me	O	
3-324	CO ₂ i-Pr	H	SMe	6-Me	O	
3-325	CO(SMe)	H	SMe	6-Me	O	NMR
3-326	H	H	H	3-OMe-5-Me	O	NMR
3-327	CO ₂ i-Pr	H	H	3-OMe-5-Me	O	NMR
3-328	CO(SiPr)	H	H	3-OMe-5-Me	O	NMR
3-329 (3-326の ジアステレオ異性体)	H	H	H	3-OMe-5-Me	O	115-118
3-330 (3-327の ジアステレオ異性体)	CO ₂ i-Pr	H	H	3-OMe-5-Me	O	NMR
3-331 (3-328の ジアステレオ異性体)	CO(SiPr)	H	H	3-OMe-5-Me	O	
3-332	H	H	Me	3-OMe	O	NMR
3-333	CO ₂ i-Pr	H	Me	3-OMe	O	NMR
3-334	CO(SiPr)	H	Me	3-OMe	O	
3-335	H	H	H	3-SMe-6-Me	O	
3-336	CO ₂ i-Pr	H	H	3-SMe-6-Me	O	NMR
3-337	CO(SiPr)	H	H	3-SMe-6-Me	O	NMR
3-338	H	H	H	3-OMe-6-Me	O	NMR
3-339	CO ₂ i-Pr	H	H	3-OMe-6-Me	O	NMR
3-340	CO(SiPr)	H	H	3-OMe-6-Me	O	NMR
3-341	H	Me	H	3-OMe	O	NMR
3-342	CO ₂ i-Pr	Me	H	3-OMe	O	NMR
3-343	CO(SMe)	Me	H	3-OMe	O	NMR
3-344	CO(SiPr)	Me	H	3-OMe	O	NMR
3-345	H	H	H	3-OMe	S	NMR
3-346	CO ₂ i-Pr	H	H	3-OMe	S	NMR
3-347	CO(SMe)	H	H	3-OMe	S	NMR
3-348	CO(SET)	H	H	3-OMe	S	NMR
3-349	CO(SnPr)	H	H	3-OMe	S	NMR
3-350	CO(SiPr)	H	H	3-OMe	S	NMR

[0200]

[表21]

第3表のつづき

No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	W	物性
3-351	CO(SiBu)	H	H	3-OMe	S	NMR
3-352	CH(CH ₃)OCOEt	H	H	3-OMe	S	NMR
3-353	H	Me	H	3-OMe	S	NMR
3-354	CO ₂ i-Pr	Me	H	3-OMe	S	NMR
3-355	CO(SMe)	Me	H	3-OMe	S	NMR
3-356	CO(SiPr)	Me	H	3-OMe	S	NMR
3-357	H	H	OMe	3-OMe	O	
3-358	CO ₂ i-Pr	H	OMe	3-OMe	O	NMR
3-359	CO(SiPr)	H	OMe	3-OMe	O	
3-360	H	H	H	3-CH ₂ OH	O	NMR
3-361	CO ₂ i-Pr	H	H	3-CH ₂ OH	O	75-77
3-362	CO(SiPr)	H	H	3-CH ₂ OH	O	NMR
3-363	CO(SiBu)	H	H	3-CH ₂ OH	O	NMR
3-364	H	H	H	3-CH ₂ OMe	O	
3-365	CO ₂ i-Pr	H	H	3-CH ₂ OMe	O	NMR
3-366	CO(SiPr)	H	H	3-CH ₂ OMe	O	
3-367	H	H	H	3-CH ₂ SMe	O	
3-368	CO ₂ i-Pr	H	H	3-CH ₂ SMe	O	NMR
3-369	CO(SiPr)	H	H	3-CH ₂ SMe	O	
3-370	H	H	H	5-CH ₂ OH	O	NMR
3-371	CO ₂ i-Pr	H	H	5-CH ₂ OH	O	
3-372	CO(SiPr)	H	H	5-CH ₂ OH	O	NMR

[0201]

[表22]

第4表

No.	¹ H-NMR δ 値ppm 測定機器: JEOL-ECX (500 MHz) 又はVARIAN Mercury plus (300 MHz)
1-1	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.52 (d, 1H), 7.16 (d, 1H), 4.47 (s, 2H), 3.43-3.46 (m, 2H), 2.33-2.36 (m, 2H), 1.72-1.83 (m, 4H).
1-3	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.68 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 4.77 (brs, 1H), 4.33 (m, 3H), 3.19 (m, 2H), 2.28 (m, 2H), 1.75 (m, 4H), 1.27 (t, 3H).
1-5	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.68 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 4.88-5.16 (m, 1H), 4.70-5.00 (br, 1H), 4.20-4.50 (br, 1H), 3.19-3.22 (m, 2H), 2.24-2.38 (m, 2H), 1.72-1.82 (m, 4H), 1.27-1.34 (m, 6H).
1-7	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.72 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 4.70-4.90 (brm, 1H), 4.30-4.50 (brm, 1H), 4.00-4.20 (br, 2H), 3.20-3.23 (m, 2H), 2.20-2.38 (m, 2H), 1.90-2.00 (m, 1H), 1.70-1.85 (brm, 4H), 0.88 (d, 6H).
1-56	(500 MHz, acetone-d ₆) 12.10-12.30 (br, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 4.66 (d, 1H), 4.27 (d, 1H), 3.90-3.75 (br, 1H), 2.45-2.23 (m, 2H), 2.00-1.88 (m, 2H), 1.82-1.60 (m, 2H), 1.36 (d, 3H).
1-58	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.68 (brs, 1H), 7.45-7.25 (br, 1H), 5.32-4.78 (br, 2H), 4.45-4.25 (br, 2H), 3.62-3.37 (br, 1H), 2.40-2.21 (br, 2H), 1.92-1.84 (br, 2H), 1.72-1.56 (m, 2H), 1.24-1.14 (m, 6H).
1-71	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.14 (s, 1H), 4.46 (d, 1H), 4.37 (d, 1H), 4.36 (q, 2H), 3.25-3.19 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.33-2.11 (m, 2H), 1.80-1.75 (m, 4H), 1.27 (t, 3H).
1-73	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.13 (s, 1H), 5.10 (sep, 1H), 4.38-4.48 (m, 2H), 3.19-3.27 (m, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.23-2.35 (m, 2H), 1.74-1.82 (m, 4H), 1.31 (d, 6H).
1-77	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.16 (s, 1H), 4.40-4.48 (m, 2H), 4.27-4.36 (m, 2H), 3.20-3.28 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.22-2.35 (m, 2H), 1.73-1.82 (m, 4H), 1.63-1.69 (m, 2H), 1.24-1.34 (m, 6H), 0.84-0.88 (m, 3H).
1-78	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.88 (d, 1H), 7.23 (s, 1H), 6.59 (dd, 1H), 6.36 (d, 1H), 4.52 (d, 1H), 4.44 (d, 1H), 3.25-3.34 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.17-2.32 (m, 2H), 1.73-1.82 (m, 4H).
1-102	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.06-7.03 (m, 1H), 5.13-5.07 (m, 1H), 4.99 (d, 1/2H), 4.79 (d, 1/2H), 4.07 (d, 1/2H), 3.89 (d, 1/2H), 3.65-3.41 (m, 1H), 2.40-2.25 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.98-1.57 (m, 2H), 1.78-1.56 (m, 2H), 1.32-1.25 (m, 6H), 1.18-1.13 (m, 3H).
1-112	(500 MHz, acetone-d ₆) 12.21 (brs, NH), 7.65 (d, 1H), 7.27 (d, 1H), 4.51 (d, 1H), 4.33 (d, 1H), 3.53 (ddd, 1H), 3.07-3.12 (m, 1H), 2.31-2.43 (m, 2H), 1.88-1.99 (m, 1H), 1.77-1.84 (m, 1H), 1.42-1.50 (m, 1H), 0.99 (d, 3H).
1-113	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.70 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 4.20-5.00 (brm, 4H), 3.20 (br, 1H), 2.80-2.85 (m, 1H), 2.20-2.40 (brm, 2H), 1.80-2.00 (m, 1H), 1.75-1.82 (m, 1H), 1.40-1.50 (m, 1H), 1.29 (t, 3H), 0.94 (d, 3H).
1-114	(500 MHz, CDCl ₃) 7.30 (d, 1H), 7.20 (d, 1H), 5.05-5.14 (m, 1H), 4.10-5.00 (brm, 2H), 3.16 (ddd, 1H), 2.40-3.10 (brm, 3H), 1.85-2.00 (br, 1H), 1.76-1.84 (brm, 1H), 1.38-1.50 (m, 1H), 1.32 (d, 6H), 0.94 (d, 3H).

[0202]

[表23]

第4表のつづき

No.	¹ H-NMR δ 値ppm 測定機器：JEOL-ECX (500 MHz) 又はVARIAN Mercury plus (300 MHz)
1-124	(500 MHz, acetone-d6) 7.12 (d, 1H), 5.12-5.05 (m, 1H), 4.55 (d, 1/2H), 4.48 (d, 1/2H), 4.33 (d, 1/2H), 4.26 (d, 1/2H), 3.28-3.15 (m, 1H), 2.90-2.81 (m, 1H), 2.38-2.24 (m, 5H), 2.10-1.75 (m, 2H), 1.55-1.40 (m, 1H), 1.30 (d, 6H), 0.96-0.92 (m, 3H).
1-126	(500 MHz, acetone-d6) 12.20 (brs, NH), 7.62 (d, 1H), 7.26 (d, 1H), 4.49 (d, 1H), 4.35 (d, 1H), 3.47-3.55 (m, 2H), 2.38-2.45 (m, 1H), 1.86-1.97 (m, 2H), 1.71-1.81 (m, 1H), 1.47-1.54 (m, 1H), 1.17 (d, 3H).
1-130	(500 MHz, acetone-d6) 7.69 (d, 1H), 7.41 (d, 1H), 5.09 (m, 1H), 4.10-5.00 (brm, 2H), 3.24 (m, 2H), 2.37 (br, 1H), 1.91-1.98 (m, 1H), 1.73-1.89 (m, 2H), 1.47-1.56 (m, 1H), 1.30-1.32 (m, 6H), 1.17 (d, 3H).
1-160	(500 MHz, acetone-d6) 7.87 (d, 1H), 7.84 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 6.65 (d, 1H), 6.59 (dd, 1H), 4.62 (brs, 2H), 3.37-3.40 (m, 2H), 2.25-2.28 (m, 2H), 1.75-1.85 (m, 4H).
1-163	(500 MHz, acetone-d6) 7.68 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 5.65 (s, 2H), 4.58 (s, 2H), 3.31 (t, 2H), 2.29 (t, 2H), 1.80-1.77 (m, 4H), 1.19 (s, 9H).
1-169	(500 MHz, acetone-d6) 7.69 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 5.69 (brs, 2H), 4.56 (brs, 2H), 4.15 (q, 2H), 3.30 (t, 2H), 2.30 (t, 2H), 1.79-1.78 (m, 4H), 1.23 (t, 3H).
1-173	(500 MHz, acetone-d6) 7.68 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 4.70-4.90 (brm, 1H), 4.20-4.50 (brm, 3H), 3.56-3.60 (m, 2H), 3.23 (s, 3H), 3.19-3.22 (m, 2H), 2.29 (br, 2H), 1.76 (br, 4H).
1-178	(500 MHz, acetone-d6) 7.73 (brs, 1H), 7.46 (brs, 1H), 5.10 (m, 1H), 4.85 (br, 1H), 4.65 (m, 1H), 4.36 (br, 1H), 3.30-3.40 (brm, 2H), 2.31-2.41 (m, 1H), 2.10-2.23 (m, 2H), 1.82-1.89 (m, 1H), 1.29-1.33 (m, 6H).
1-180	(500 MHz, acetone-d6) 11.65 (brs, NH), 7.64 (d, 1H), 7.31 (d, 1H), 4.47 (d, 1H), 4.43 (d, 1H), 4.07 (dd, 1H), 3.48-3.56 (m, 2H), 2.05-2.11 (m, 1H), 1.92-1.99 (m, 1H), 1.81-1.89 (m, 1H), 1.64-1.72 (m, 1H).
1-181	(500 MHz, acetone-d6) 7.72 (brs, 1H), 7.50 (brs, 1H), 5.08 (m, 1H), 4.60-5.53 (br, 1H), 4.15-4.45 (br, 1H), 4.00 (br, 1H), 3.93 (s, OH), 3.24 (br, 2H), 2.10-2.16 (m, 1H), 1.79-1.95 (m, 2H), 1.61-1.71 (m, 1H), 1.29-1.32 (m, 6H).
1-183	(500 MHz, acetone-d6) 11.82 (brs, NH), 7.64 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 4.48 (d, 1H), 4.41 (d, 1H), 3.71 (dd, 1H), 3.43-3.54 (m, 5H), 1.72-1.97 (m, 4H).
1-184	(500 MHz, acetone-d6) 7.71 (brs, 1H), 7.43 (brs, 1H), 5.10 (m, 1H), 4.15-5.00 (br, 2H), 3.66 (brm, 1H), 3.51 (s, 3H), 3.20 (br, 2H), 1.69-2.00 (m, 4H), 1.31-1.33 (m, 6H).
1-185	(500 MHz, acetone-d6) 7.95 (brs, 1H), 7.49 (brs, 0.5H), 7.43 (brs, 0.5H), 4.74 (brd, 0.5H), 4.37-4.55 (brm, 1.5H), 3.68 (m, 1H), 3.54-3.62 (m, 1H), 3.51 (s, 3H), 3.20-3.37 (br, 2H), 1.81-2.03 (m, 3H), 1.73-1.79 (m, 1H), 1.31 (brm, 6H).

[0203]

[表24]

第4表のつづき

No.	¹ H-NMR δ 値ppm 測定機器: JEOL-ECX (500 MHz) 又はVARIAN Mercury plus (300 MHz)
1-186	(500 MHz, acetone-d6) 7.96 (brs, 1H), 7.44-7.50 (br, 1H), 4.56-4.70 (m, 1H), 4.40-4.49 (m, 1H), 3.64-3.69 (m, 1H), 3.50 (s, 3H), 3.20-3.36 (br, 2H), 2.94 (q, 2H), 1.71-2.03 (m, 4H), 1.25 (t, 3H).
1-188	(500 MHz, acetone-d6) 7.72 (d, 1H), 7.50 (d, 1H), 5.24 (br, 1H), 5.09 (m, 1H), 4.60-5.00 (br, 1H), 4.33 (d, 1H), 3.29 (br, 2H), 2.06-2.13 (m, 1H), 2.03 (s, 3H), 1.85-1.98 (m, 3H), 1.30-1.32 (m, 6H).
1-191	(500 MHz, acetone-d6) 7.11-7.15 (m, 2H), 6.91 (s, 0.5H), 6.86-6.90 (m, 2H), 6.84 (s, 0.5H), 4.92-4.96 (m, 1H), 4.77-4.81 (m, 1H), 4.40 (d, 0.5H), 4.28 (d, 0.5H), 3.95 (d, 0.5H), 3.70-3.80 (m, 0.5H), 3.78 (s, 3H), 3.61-3.65 (m, 1H), 3.47 (s, 1.5H), 3.45 (s, 1.5H), 2.90-3.10 (m, 2H), 2.11 (s, 1.5H), 2.07 (s, 1.5H), 1.83-2.00 (m, 3H), 1.67-1.74 (m, 1H).
1-195	(500 MHz, acetone-d6) 7.13 (s, 0.5H), 7.10 (s, 0.5H), 5.07-5.17 (m, 1H), 4.45-4.49 (m, 1H), 4.32-4.38 (m, 1H), 3.62-3.67 (m, 1H), 3.50 (s, 1.5H), 3.49 (s, 1.5H), 3.17-3.25 (m, 2H), 2.37 (m, 3H), 1.69-2.02 (m, 4H), 1.31-1.33 (m, 6H).
1-198	(500 MHz, acetone-d6) 7.18 (s, 0.5H), 7.13 (s, 0.5H), 4.50-4.55 (m, 1H), 4.27-4.33 (m, 1H), 3.66-3.70 (m, 1H), 3.56-3.64 (m, 1H), 3.50 (s, 3H), 3.26-3.35 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 1.85-2.04 (m, 3H), 1.73-1.82 (m, 1H), 1.32 (d, 6H).
1-208	(500 MHz, acetone-d6) 7.97 (brs, 1H), 7.50 (brs, 0.6H), 7.44 (brs, 0.4H), 4.69 (d, 0.6H), 4.57 (d, 0.4H), 4.45 (d, 1H), 3.64-3.71 (m, 1H), 3.50 (s, 3H), 3.20-3.37 (br, 2H), 2.88-2.95 (m, 2H), 1.71-2.03 (m, 4H), 1.63 (dq, 2H), 0.94 (t, 3H).
1-209	(500 MHz, acetone-d6) 7.72 (brs, 1H), 7.51 (brs, 1H), 5.09 (m, 1H), 4.60-5.20 (br, 1H), 4.85 (ddd, 1H), 4.20-4.40 (br, 1H), 3.10-3.40 (brm, 2H), 2.15-2.25 (m, 1H), 1.91-2.08 (m, 2H), 1.80-1.88 (m, 1H), 1.30-1.33 (m, 6H).
1-210	(500 MHz, acetone-d6) 7.93 (m, 1H), 7.44 (m, 1H), 4.84 (d, 0.5H), 4.58 (d, 0.5H), 4.46 (d, 0.5H), 4.26 (d, 0.5H), 3.58 (m, 1H), 3.31 (br, 2H), 2.40 (br, 1H), 1.95-2.00 (m, 1H), 1.76-1.93 (m, 2H), 1.55 (br, 1H), 1.31 (br, 6H), 1.18-1.19 (m, 3H).
1-211	(500 MHz, acetone-d6) 7.14 (s, 0.5H), 7.13 (s, 0.5H), 4.67-4.70 (m, 0.5H), 4.38-4.45 (m, 1H), 4.13-4.16 (m, 0.5H), 3.55-3.64 (m, 1H), 3.29-3.38 (m, 2H), 2.35-2.46 (m, 4H), 1.95-2.04 (m, 1H), 1.77-1.94 (m, 2H), 1.51-1.61 (m, 1H), 1.32 (m, 6H), 1.17-1.20 (m, 3H).
1-212	(500 MHz, acetone-d6) 7.98 (brs, 1H), 7.43-7.50 (brm, 1H), 4.40-4.78 (brm, 2H), 3.65-3.71 (m, 1H), 3.50 (s, 3H), 3.20-3.37 (br, 2H), 2.84-2.88 (m, 2H), 1.72-2.04 (m, 5H), 0.94 (d, 6H).
1-213	(500 MHz, acetone-d6) 7.92 (brs, 1H), 7.43 (br, 1H), 4.30-4.84 (brm, 2H), 3.68-3.71 (m, 1H), 3.51 (s, 3H), 3.20-3.38 (br, 2H), 1.74-2.04 (m, 4H), 1.47 (s, 9H).
1-214	(500 MHz, acetone-d6) 7.73 (brs, 1H), 7.46 (brs, 1H), 4.65-4.85 (brm, 1H), 4.29-4.36 (m, 3H), 3.65 (m, 1H), 3.51 (s, 3H), 3.20 (br, 2H), 1.77-2.01 (m, 3H), 1.62-1.76 (m, 3H), 1.22-1.35 (m, 6H), 0.86 (t, 3H).

[表25]

第4表のつづき

No.	¹ H-NMR δ 値ppm 測定機器: JEOL-ECX (500 MHz) 又はVARIAN Mercury plus (300 MHz)
2-1	(500 MHz, acetone-d6) 12.34 (brs, NH), 7.00 (s, 1H), 4.41 (s, 2H), 3.49-3.52 (m, 2H), 2.55 (s, 3H), 2.34-2.37 (m, 2H), 1.75-1.84 (m, 4H).
2-3	(500 MHz, acetone-d6) 7.43 (s, 1H), 4.95 (d, 1H), 4.27-4.42 (m, 2H), 4.23 (d, 1H), 3.10-3.12 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 2.20-2.33 (m, 2H), 1.66-1.80 (m, 4H), 1.29 (t, 3H).
2-5	(500 MHz, acetone-d6) 7.42 (s, 1H), 5.08 (sep, 1H), 5.01 (d, 1H), 4.18 (d, 1H), 3.09-3.11 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 2.20-2.35 (m, 2H), 1.68-1.78 (m, 4H), 1.30-1.33 (m, 6H).
2-7	(500 MHz, acetone-d6) 7.45 (s, 1H), 4.93 (d, 1H), 4.27 (d, 1H), 4.12 (dd, 1H), 4.05 (dd, 1H), 3.10-3.13 (m, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.19-2.24 (m, 2H), 1.92-2.01 (m, 1H), 1.67-1.78 (m, 4H), 0.89-0.91 (m, 6H).
2-9	(500 MHz, acetone-d6) 7.44 (s, 1H), 4.99 (d, 1H), 4.43-4.47 (m, 1H), 4.33-4.37 (m, 1H), 4.21 (d, 1H), 3.56-3.65 (m, 2H), 3.27 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 2.20-2.35 (m, 2H), 1.68-1.78 (m, 4H).
2-10	(500 MHz, acetone-d6) 7.85 (d, 1H), 7.63 (s, 1H), 6.58 (dd, 1H), 6.30 (d, 1H), 4.50-4.70 (brm, 2H), 3.22-3.26 (m, 2H), 2.54 (s, 3H), 2.07-2.11 (m, 2H), 1.59-1.69 (m, 4H).
3-1	(500 MHz, acetone-d6) 11.75 (brs, NH), 7.47 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 4.63 (d, 1H), 4.57 (d, 1H), 3.70-3.73 (m, 1H), 3.64 (ddd, 1H), 3.47-3.52 (m, 1H), 3.29 (s, 3H), 2.61 (dd, 1H), 2.37-2.42 (m, 1H), 1.97-2.05 (m, 2H).
3-3	(500 MHz, acetone-d6) 7.49 (d, 1H), 6.99 (d, 1H), 4.50-5.00 (brm, 2H), 4.36 (q, 2H), 3.66-3.71 (m, 1H), 3.41 (br, 1H), 3.30 (s, 3H), 3.23 (br, 1H), 2.59 (dd, 1H), 2.33-2.38 (m, 1H), 1.98-2.05 (m, 1H), 1.87-1.93 (m, 1H), 1.27 (t, 3H).
3-6	(500 MHz, acetone-d6) 7.50 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 4.40-5.00 (m, 3H), 3.66-3.72 (m, 1H), 3.36-3.44 (m, 1H), 3.30 (s, 3H), 3.18-3.26 (m, 1H), 2.59 (dd, 1H), 2.36 (dd, 1H), 1.98-2.08 (m, 1H), 1.86-1.93 (m, 1H), 1.58-1.68 (m, 2H), 0.85-0.89 (m, 3H), 1.28-1.30 (m, 3H).
3-12	(500 MHz, acetone-d6) 7.59 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 4.77 (d, 1H), 4.68 (br, 1H), 3.70-3.74 (m, 1H), 3.58 (sep, 1H), 3.47 (ddd, 1H), 3.26-3.33 (m, 4H), 2.59-2.64 (m, 1H), 2.37-2.41 (m, 1H), 2.00-2.07 (m, 1H), 1.90-1.97 (m, 1H), 1.31 (br, 6H).
3-14	(500 MHz, acetone-d6) 7.88 (d, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.09 (d, 1H), 6.67 (d, 1H), 6.61 (dd, 1H), 4.79 (d, 1H), 4.75 (d, 1H), 3.67-3.71 (m, 1H), 3.44 (ddd, 1H), 3.23-3.31 (m, 4H), 2.55 (dd, 1H), 2.31-2.36 (m, 1H), 1.97-2.07 (m, 1H), 1.87-1.95 (m, 1H).
3-25	(500 MHz, acetone-d6) 7.49 (d, 1H), 6.97 (d, 1H), 5.09 (sep, 1H), 4.40-5.00 (br, 2H), 3.77-3.82 (m, 1H), 3.37-3.55 (m, 3H), 3.18-3.26 (m, 1H), 2.58 (dd, 1H), 2.35 (ddd, 1H), 1.97-2.08 (m, 1H), 1.85-1.92 (m, 1H), 1.29-1.31 (m, 6H), 1.12 (t, 3H).
3-73	(500 MHz, acetone-d6) 7.49 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 5.09 (sep, 1H), 4.40-5.00 (m, 4H), 4.02-4.07 (m, 1H), 3.40-3.49 (m, 1H), 3.22-3.30 (m, 4H), 2.62 (dd, 1H), 2.40-2.44 (m, 1H), 2.00-2.08 (m, 1H), 1.88-1.95 (m, 1H), 1.30 (d, 6H).

[0205]

[表26]

第4表のつづき

No.	¹ H-NMR δ 値ppm 測定機器: JEOL-ECX (500 MHz) 又はVARIAN Mercury plus (300 MHz)
3-89	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.49 (d, 1H), 6.97 (d, 1H), 5.09 (sep, 1H), 4.40-5.00 (brm, 2H), 3.83-3.87 (m, 1H), 3.56-3.64 (m, 2H), 3.39-3.46 (m, 3H), 3.18-3.26 (m, 4H), 2.60 (dd, 1H), 2.37 (ddd, 1H), 1.98-2.09 (m, 1H), 1.88-1.95 (m, 1H), 1.29-1.31 (m, 6H).
3-105	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.49 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 5.06-5.12 (m, 1H), 4.50-4.95 (m, 3H), 4.10-4.14 (m, 1H), 3.78-3.84 (m, 1H), 3.40-3.54 (m, 2H), 3.20-3.30 (m, 1H), 2.56-2.66 (m, 1H), 2.36-2.48 (m, 1H), 1.88-2.05 (m, 2H), 1.72-1.82 (m, 1H), 1.58-1.68 (m, 1H), 1.40-1.56 (m, 4H), 1.30 (m, 6H). ジアステレオ異性体混合物
3-199	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.46 (d, 1H), 6.96 (d, 1H), 5.10 (sep, 1H), 4.90-5.30 (br, 1H), 4.20-4.60 (br, 1H), 3.77-3.82 (m, 1H), 3.67 (br, 1H), 3.30 (s, 3H), 2.77 (ddd, 1H), 2.33 (dd, 1H), 1.86-1.98 (m, 2H), 1.30 (d, 6H), 1.26 (d, 3H). 主のジアステレオマー
3-207-1	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.46 (d, 1H), 6.96 (d, 1H), 5.10 (sep, 1H), 4.90-5.35 (br, 1H), 4.20-4.60 (br, 1H), 3.87-3.92 (m, 1H), 3.67 (br, 1H), 3.50 (q, 2H), 2.68 (dd, 1H), 2.33 (dd, 1H), 1.87-1.95 (m, 2H), 1.30 (d, 6H), 1.25 (d, 3H), 1.11 (t, 3H).
3-207-2	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.46 (d, 1H), 6.96 (d, 1H), 5.10 (sep, 1H), 4.90-5.40 (br, 1H), 4.20-4.60 (br, 1H), 3.68-3.73 (m, 1H), 3.45-3.65 (m, 3H), 2.68 (ddd, 1H), 2.31 (dd, 1H), 2.19-2.24 (m, 1H), 1.62-1.68 (m, 1H), 1.29-1.33 (m, 9H), 1.13 (t, 3H).
3-235	(500 MHz, acetone-d ₆) 11.54 (brs, NH), 7.47 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 4.64 (d, 1H), 4.57 (d, 1H), 3.69-3.71 (m, 1H), 3.47-3.57 (m, 5H), 1.76-1.99 (m, 4H).
3-236	(300 MHz, CDCl ₃) 7.27 (d, 1H), 6.81 (d, 1H), 4.60-4.80 (m, 2H), 4.33-4.38 (m, 2H), 3.74-3.77 (m, 1H), 3.56 (s, 3H), 3.23-3.28 (m, 2H), 1.87-2.03 (m, 2H), 1.69-1.80 (m, 2H), 1.33 (t, 3H).
3-237	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.50 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 5.10 (sep, 1H), 4.50-4.90 (br, 2H), 3.67 (dd, 1H), 3.50 (s, 3H), 3.22-3.32 (m, 2H), 1.90-1.99 (m, 2H), 1.70-1.89 (m, 2H), 1.30 (d, 6H).
3-241	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.50 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 5.10 (m, 1H), 4.50-4.90 (br, 2H), 3.93 (dq, 1H), 3.78 (dd, 1H), 3.59 (dq, 1H), 3.22-3.33 (m, 2H), 1.92-2.00 (m, 2H), 1.82-1.89 (m, 1H), 1.71-1.78 (m, 1H), 1.29-1.31 (m, 6H), 1.13 (t, 3H).
3-259	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.56 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 5.10-5.30 (br, 1H), 4.30-4.55 (br, 1H), 3.79-3.84 (m, 0.6H), 3.68-3.75 (m, 0.6H), 3.60-3.67 (m, 0.8H), 3.32 (s, 1.2H), 3.31 (s, 1.8H), 2.68-2.75 (m, 1H), 2.32-2.38 (m, 4H), 2.22-2.27 (m, 0.4H), 1.86-2.00 (m, 1.2H), 1.66-1.72 (m, 0.4H), 1.35 (d, 1.2H), 1.29 (d, 1.8H). 約6:4のジアステレオマー混合物
3-278	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.49 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 5.09 (sep, 1H), 4.80 (d, 1H), 4.78 (d, 1H), 4.40-5.00 (br, 2H), 4.11-4.15 (m, 1H), 3.76-3.86 (m, 2H), 3.67-3.74 (m, 2H), 3.45 (br, 1H), 3.26 (brm, 1H), 2.64 (dd, 1H), 2.43 (dd, 1H), 2.02-2.10 (m, 1H), 1.91-1.97 (m, 1H), 1.30 (d, 6H).

[表27]

第4表のつづき

No.	¹ H-NMR δ 値ppm 測定機器: JEOL-ECX (500 MHz) 又はVARIAN Mercury plus (300 MHz)
3-281	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.50 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 5.09 (m, 1H), 4.74 (d, 1H), 4.72 (d, 1H), 4.40-5.00 (br, 2H), 4.06-4.10 (m, 1H), 3.60-3.67 (m, 2H), 3.40-3.50 (m, 3H), 3.21-3.30 (m, 4H), 2.63 (dd, 1H), 2.42 (ddd, 1H), 2.02-2.09 (m, 1H), 1.89-1.96 (m, 1H), 1.301 (d, 3H), 1.299 (d, 3H).
3-284	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.49 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 5.09 (m, 1H), 4.71 (d, 1H), 4.69 (d, 1H), 4.40-5.00 (br, 2H), 4.04-4.08 (m, 1H), 3.51-3.60 (m, 2H), 3.44 (brm, 1H), 3.26 (brm, 1H), 2.62 (dd, 1H), 2.42 (ddd, 1H), 2.01-2.08 (m, 1H), 1.88-1.95 (m, 1H), 1.300 (d, 3H), 1.298 (d, 3H), 1.13 (t, 3H).
3-286	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.61 (d, 1H), 7.06 (d, 1H), 4.55-4.90 (brm, 2H), 3.67-3.70 (m, 1H), 3.51 (s, 3H), 3.30-3.39 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.92-1.99 (m, 2H), 1.73-1.90 (m, 2H).
3-287	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.60 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 4.60-4.85 (brm, 2H), 3.68-3.70 (m, 1H), 3.51 (s, 3H), 3.30-3.40 (m, 2H), 2.94 (q, 2H), 1.93-2.01 (m, 2H), 1.73-1.90 (m, 2H), 1.25 (t, 3H).
3-288	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.60 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 4.60-4.80 (brm, 2H), 3.68-3.71 (m, 1H), 3.59 (sep, 1H), 3.51 (s, 3H), 3.30-3.40 (brm, 2H), 1.94-2.00 (m, 2H), 1.73-1.91 (m, 2H), 1.31 (brd, 6H).
3-289	(300 MHz, CDCl ₃) 7.34 (d, 1H), 6.86 (d, 1H), 5.00 (brs, 1H), 4.47 (brs, 1H), 3.76-3.79 (m, 1H), 3.58 (s, 3H), 3.32-3.37 (m, 2H), 2.81 (d, 2H), 1.74-2.04 (m, 5H), 0.94 (d, 6H).
3-290	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.93-7.98 (m, 3H), 7.77-7.80 (m, 2H), 7.48-7.50 (m, 1H), 6.81-6.83 (m, 1H), 4.37-4.43 (m, 1H), 4.25 (d, 0.5H), 4.18 (d, 0.5H), 3.65-3.67 (m, 1H), 3.49 (s, 3H), 3.07-3.20 (m, 2H), 1.81-1.99 (m, 3H), 1.68-1.75 (m, 1H).
3-291	(300 MHz, CDCl ₃) 7.27 (d, 1H), 6.82 (d, 1H), 4.51-4.81 (m, 2H), 4.10-4.46 (m, 2H), 3.73-3.77 (m, 1H), 3.55-3.56 (m, 4H), 3.33 (s, 3H), 3.27-3.33 (m, 2H), 1.87-2.02 (m, 3H), 1.69-1.79 (m, 2H).
3-292	(300 MHz, CDCl ₃) 7.26 (d, 1H), 6.81 (d, 1H), 4.44-4.82 (m, 2H), 4.27-4.31 (m, 2H), 3.73-3.77 (m, 1H), 3.33 (s, 3H), 3.24-3.26 (m, 2H), 1.62-1.93 (m, 6H), 1.28 (br, 6H), 0.88 (br, 3H).
3-293	(500 MHz, acetone-d ₆) 11.59 (brs, NH), 7.47 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 4.64 (d, 1H), 4.56 (d, 1H), 3.75-3.82 (m, 2H), 3.47-3.58 (m, 3H), 1.77-2.02 (m, 4H), 1.48-1.55 (m, 2H), 0.86 (t, 3H).
3-294	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.50 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 5.10 (sep, 1H), 4.50-4.90 (br, 2H), 3.84 (dt, 1H), 3.77 (dd, 1H), 3.50 (dt, 1H), 3.22-3.33 (m, 2H), 1.83-2.01 (m, 3H), 1.70-1.79 (m, 1H), 1.51-1.58 (m, 2H), 1.30 (d, 6H), 0.90 (t, 3H).
3-295	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.60 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 4.60-4.80 (br, 2H), 3.85 (dt, 1H), 3.79-3.81 (m, 1H), 3.59 (sep, 1H), 3.51 (dt, 1H), 3.30-3.43 (brm, 2H), 1.85-2.02 (m, 3H), 1.73-1.80 (m, 1H), 1.50-1.59 (m, 2H), 1.31 (brd, 6H), 0.90 (t, 3H).
3-296	(500 MHz, acetone-d ₆) 11.57 (brs, NH), 7.47 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 4.64 (d, 1H), 4.56 (d, 1H), 3.77-3.84 (m, 2H), 3.48-3.58 (m, 3H), 1.77-2.01 (m, 4H), 1.45-1.51 (m, 2H), 1.28-1.37 (m, 2H), 0.87 (t, 3H).

[表28]

第4表のつづき

No.	¹ H-NMR δ 値ppm 測定機器：JEOL-ECX (500 MHz) 又はVARIAN Mercury plus (300 MHz)
3-297	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.50 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 5.10 (m, 1H), 4.40-5.00 (br, 2H), 3.89 (dt, 1H), 3.77 (dd, 1H), 3.54 (dt, 1H), 3.22-3.34 (m, 2H), 1.83-2.01 (m, 3H), 1.71-1.78 (m, 1H), 1.49-1.55 (m, 2H), 1.34-1.41 (m, 2H), 1.301 (d, 3H), 1.298 (d, 3H), 0.90 (t, 3H).
3-299	(500 MHz, acetone-d ₆) 11.20 (brs, NH), 7.47 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 4.65 (s, 2H), 4.43 (dq, 1H), 4.21 (dq, 1H), 4.09 (dd, 1H), 3.50-3.60 (m, 2H), 2.07-2.14 (m, 1H), 1.82-2.02 (m, 3H).
3-300	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.52 (d, 1H), 6.99 (d, 1H), 5.10 (sep, 1H), 4.40-5.00 (m, 3H), 4.22 (dq, 1H), 4.04 (dd, 1H), 3.24-3.37 (brm, 2H), 2.07-2.14 (m, 1H), 1.77-2.00 (m, 3H), 1.30 (d, 6H).
3-301	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.62 (d, 1H), 7.06 (d, 1H), 4.78 (d, 1H), 4.70 (brd, 1H), 4.50 (dq, 1H), 4.23 (dq, 1H), 4.08 (dd, 1H), 3.59 (m, 1H), 3.39 (br, 2H), 2.12-2.17 (m, 1H), 1.81-2.02 (m, 3H), 1.31 (br, 6H).
3-302	(500 MHz, acetone-d ₆) 11.53 (brs, NH), 7.48 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 4.65 (d, 1H), 4.60 (d, 1H), 3.53-3.61 (m, 2H), 3.39-3.41 (m, 1H), 2.26 (s, 3H), 2.16-2.23 (m, 1H), 1.94-2.02 (m, 1H), 1.81-1.91 (m, 2H).
3-304	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.50 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 5.10 (m, 1H), 4.70 (br, 2H), 3.26-3.40 (m, 3H), 2.27 (s, 3H), 2.17-2.23 (m, 1H), 1.87-2.03 (m, 2H), 1.75-1.82 (m, 1H), 1.29-1.31 (m, 6H).
3-305	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.52 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 4.74 (d, 1H), 4.69 (d, 1H), 4.11 (brs, 2H), 3.27-3.40 (m, 3H), 2.27 (s, 3H), 2.16-2.23 (m, 1H), 1.86-2.03 (m, 3H), 1.75-1.82 (m, 1H), 0.87 (d, 6H).
3-306	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.61 (d, 1H), 7.06 (d, 1H), 4.40-5.10 (brm, 2H), 3.34-3.45 (m, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.19-2.27 (m, 1H), 1.88-2.04 (m, 2H), 1.77-1.84 (m, 1H).
3-308	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.60 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 4.50-4.95 (brm, 2H), 3.59 (sep, 1H), 3.34-3.47 (m, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.19-2.26 (m, 1H), 1.97-2.04 (m, 1H), 1.89-1.96 (m, 1H), 1.78-1.85 (m, 1H), 1.31 (d, 6H).
3-309	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.539 (d, 0.2H), 7.535 (d, 0.8H), 7.03 (d, 1H), 4.66-4.86 (brm, 2H), 4.10 (br, 2H), 3.84 (dd, 0.2H), 3.54 (dd, 0.8H), 3.40 (br, 2H), 2.75 (s, 2.4H), 2.56 (s, 0.6H), 1.81-2.30 (m, 5H), 0.87 (d, 6H). 約4:1のジアステレオマー混合物
3-310	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.55 (d, 1H), 7.03 (d, 1H), 4.88 (br, 1H), 4.73 (d, 1H), 4.05-4.20 (brm, 3H), 3.43 (br, 2H), 3.24 (s, 3H), 2.35-2.41 (m, 1H), 2.16-2.23 (m, 1H), 2.05-2.14 (m, 1H), 1.89-2.00 (m, 1H), 1.78-1.86 (m, 1H), 0.88 (d, 6H).
3-311	(500 MHz, acetone-d ₆) 11.54 (brs, NH), 7.47 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 4.64 (d, 1H), 4.59 (d, 1H), 3.49-3.61 (m, 3H), 2.81-2.88 (m, 1H), 2.73 (dq, 1H), 2.16-2.23 (m, 1H), 1.94-2.02 (m, 1H), 1.81-1.90 (m, 2H), 1.22 (t, 3H).
3-312	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.50 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 5.10 (m, 1H), 4.69 (br, 2H), 3.49 (dd, 1H), 3.27-3.38 (m, 2H), 2.88 (dq, 1H), 2.73 (dq, 1H), 2.16-2.23 (m, 1H), 1.95-2.04 (m, 1H), 1.85-1.91 (m, 1H), 1.75-1.82 (m, 1H), 1.305 (d, 3H), 1.300 (d, 3H), 1.25 (t, 3H).

[0208]

[表29]

第4表のつづき

No.	¹ H-NMR δ 値ppm 測定機器: JEOL-ECX (500 MHz) 又はVARIAN Mercury plus (300 MHz)
3-314	(500 MHz, acetone-d ₆) 11.26 (brs, NH), 7.46 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 6.13 (ddt, 1H), 4.73 (d, 1H), 4.59 (d, 1H), 3.67-3.69 (m, 1H), 3.53-3.62 (m, 2H), 3.42 (ddd, 1H), 3.08-3.18 (m, 1H), 2.20-2.28 (m, 1H), 1.83-2.01 (m, 3H).
3-315	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.52 (d, 1H), 6.99 (d, 1H), 6.19 (ddt, 1H), 5.10 (m, 1H), 4.72 (br, 2H), 3.64-3.67 (m, 1H), 3.30-3.51 (m, 3H), 3.08-3.19 (m, 1H), 2.22-2.28 (m, 1H), 1.79-2.00 (m, 3H), 1.29-1.31 (m, 6H).
3-316	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.62 (d, 1H), 7.06 (d, 1H), 6.19 (ddt, 1H), 4.52-4.98 (brm, 2H), 3.67-3.69 (m, 1H), 3.59 (sep, 1H), 3.40-3.51 (m, 3H), 3.09-3.20 (m, 1H), 2.24-2.31 (m, 1H), 1.82-2.04 (m, 3H), 1.31 (brd, 6H).
3-320	(500 MHz, acetone-d ₆) 11.69 (brs, NH), 7.47 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 4.63 (d, 1H), 4.60 (d, 1H), 3.86 (ddd, 1H), 3.50 (dd, 1H), 3.14-3.19 (m, 1H), 2.40-2.55 (m, 2H), 2.14 (s, 3H), 2.10-2.15 (m, 1H), 1.80-1.88 (m, 1H).
3-325	[ジアステレオマーA] (500 MHz, acetone-d ₆) 7.59 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 5.20-5.40 (br, 1H), 4.20-4.40 (br, 1H), 3.72-3.78 (m, 1H), 3.28-3.34 (m, 1H), 2.76-2.81 (m, 1H), 2.38 (s, 3H), 2.27-2.32 (m, 1H), 2.13 (s, 3H), 2.03-2.09 (m, 1H), 1.83-1.95 (m, 1H), 1.32 (d, 3H). [ジアステレオマーB] (500 MHz, acetone-d ₆) 7.57 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 5.00-5.25 (br, 1H), 4.50-4.65 (br, 1H), 3.63-3.69 (m, 1H), 2.93-2.98 (m, 1H), 2.67-2.72 (m, 1H), 2.29-2.41 (m, 5H), 2.13 (s, 3H), 1.58 (dd, 1H), 1.32 (d, 3H).
3-326	(500 MHz, acetone-d ₆) 11.46 (brs, NH), 7.48 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 4.64 (d, 1H), 4.55 (d, 1H), 3.79 (dd, 1H), 3.47-3.52 (m, 4H), 3.19 (dd, 1H), 2.07-2.16 (m, 2H), 1.41-1.49 (m, 1H), 1.02 (d, 3H).
3-327	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.50 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 5.10 (sep, 1H), 4.40-5.00 (br, 2H), 3.74 (dd, 1H), 3.55 (s, 3H), 3.22 (br, 1H), 2.95 (dd, 1H), 2.03-2.13 (m, 2H), 1.44-1.51 (m, 1H), 1.31 (d, 6H), 0.97 (d, 3H).
3-328	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.61 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 4.79 (brd, 1H), 4.60 (d, 1H), 3.77 (dd, 1H), 3.55-3.63 (m, 4H), 3.30 (br, 1H), 3.02 (brm, 1H), 2.05-2.16 (m, 2H), 1.46-1.53 (m, 1H), 1.31 (br, 6H), 0.99 (d, 3H).
3-330	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.51 (d, 1H), 6.99 (d, 1H), 5.10 (m, 1H), 4.68 (br, 2H), 3.62-3.64 (m, 1H), 3.47 (s, 3H), 3.26-3.30 (m, 1H), 2.89-2.94 (m, 1H), 2.18-2.29 (m, 1H), 1.93-1.97 (m, 1H), 1.60 (ddd, 1H), 1.30-1.32 (m, 6H), 0.94 (d, 3H).
3-332	(500 MHz, acetone-d ₆) 11.53 (brs, NH), 11.47 (brs, NH), 7.48 (m, 1H), 7.11 (m, 1H), 4.55-4.65 (m, 2H), 3.49-3.56 (m, 3.8H), 3.48 (s, 1.8H), 3.34 (d, 0.4H), 1.58-1.84 (m, 1.6H), 1.88-2.08 (m, 1.4H), 1.01 (d, 1.2H), 0.97 (d, 1.8H). 約4:6のジアステレオマー混合物
3-333	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.50 (m, 1H), 6.98 (m, 1H), 5.06-5.14 (m, 1H), 4.40-4.95 (br, 2H), 3.36 (s, 1.2H), 3.53 (d, 0.6H), 3.51 (s, 1.8H), 3.20-3.34 (m, 2.4H), 2.02-2.10 (m, 0.4H), 1.89-1.98 (m, 1H), 1.76-1.84 (m, 0.6H), 1.67-1.73 (m, 0.6H), 1.52-1.60 (m, 0.4H), 1.29-1.31 (m, 6H), 1.03 (d, 1.2H), 0.99 (d, 1.8H). 約4:6のジアステレオマー混合物

[表30]

第4表のつづき

No.	¹ H-NMR δ 値ppm 測定機器: JEOL-ECX (500 MHz) 又はVARIAN Mercury plus (300 MHz)
3-336	(300 MHz, CDCl ₃) 7.24-7.28 (m, 1H), 6.79 (d, 1H), 5.07-5.27 (m, 2H), 4.14-4.32 (m, 1H), 3.58 (brm, 1H), 3.39-3.44 (m, 1H), 2.24-2.35 (m, 3H), 1.77-2.17 (m, 4H), 1.23-1.34 (m, 9H).
3-337	(300 MHz, CDCl ₃) 7.28-7.34 (m, 1H), 6.84 (d, 1H), 4.57-5.54 (m, 1H), 4.03-4.21 (m, 1H), 3.59-3.77 (m, 2H), 3.40-3.46 (m, 1H), 2.20-2.52 (m, 3H), 1.82-2.19 (m, 4H), 1.27-1.54 (m, 9H).
3-338	(300 MHz, CDCl ₃) 10.60-10.67 (m, 1H), 7.14-7.22 (m, 2H), 4.66-4.89 (m, 2H), 4.12-4.27 (m, 1H), 3.69-3.77 (m, 2H), 3.52-3.54 (m, 3H), 1.83-2.20 (m, 3H), 1.42-1.48 (m, 3H).
3-339	(300 MHz, CDCl ₃) 7.23-7.27 (m, 1H), 6.77-6.81 (m, 1H), 5.01-5.23 (m, 2H), 4.16-4.26 (m, 1H), 3.69-3.80 (m, 1H), 3.50-3.61 (m, 4H), 1.84-2.18 (m, 4H), 1.20-1.35 (m, 9H).
3-340	(300 MHz, CDCl ₃) 7.29-7.31 (m, 1H), 6.85 (brm, 1H), 5.03-5.45 (m, 1H), 4.08-4.49 (m, 1H), 3.71-3.82 (m, 1H), 3.53-3.62 (m, 5H), 1.73-2.18 (m, 4H), 1.30-1.54 (m, 9H).
3-341	(300 MHz, CDCl ₃) 10.03 (brs, 1H), 6.87 (s, 1H), 4.39-4.50 (m, 2H), 3.62-3.75 (m, 1H), 3.40-3.52 (m, 5H), 2.27 (s, 3H), 1.73-2.05 (m, 4H).
3-342	(300 MHz, CDCl ₃) 6.93 (s, 1H), 5.10-5.15 (m, 1H), 4.58-4.72 (m, 2H), 3.72-4.13 (m, 1H), 3.58 (s, 3H), 3.17-3.23 (m, 2H), 1.92-2.00 (m, 3H), 1.71-1.74 (m, 1H), 1.33 (d, 6H).
3-343	(300 MHz, CDCl ₃) 7.01 (s, 1H), 4.97 (dd, 1H), 4.41 (dd, 1H), 3.75-3.79 (m, 1H), 3.57 (s, 3H), 3.20-3.40 (m, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 1.75-2.04 (m, 4H).
3-344	(300 MHz, CDCl ₃) 7.00 (s, 1H), 4.97 (dd, 1H), 4.39 (dd, 1H), 3.76-3.79 (m, 1H), 3.50-3.62 (m, 4H), 3.26-3.32 (m, 2H), 2.15 (s, 3H), 1.94-2.15 (m, 2H), 1.61-1.82 (m, 2H), 1.33 (d, 6H).
3-345	(300 MHz, CDCl ₃) 10.28 (s, 1H), 7.25-7.27 (m, 1H), 7.14 (d, 1H), 5.05-5.24 (m, 2H), 4.12-4.22 (m, 1H), 3.80-3.86 (m, 1H), 3.51-3.61 (m, 4H), 1.79-2.10 (m, 4H).
3-346	(300 MHz, CDCl ₃) 7.27 (d, 1H), 6.82 (d, 1H), 5.38 (brm, 2H), 5.07-5.16 (m, 1H), 4.26-4.28 (m, 1H), 3.54-3.65 (m, 4H), 3.30-3.39 (m, 1H), 1.96-2.08 (m, 2H), 1.71-1.91 (m, 2H), 1.33-1.41 (m, 6H).
3-347	(300 MHz, CDCl ₃) 7.34 (d, 1H), 6.89 (d, 1H), 5.85 (brm, 1H), 4.93 (brm, 1H), 4.27 (brm, 1H), 3.61-3.86 (m, 1H), 3.52 (s, 3H), 3.41 (brm, 1H), 2.36 (s, 3H), 1.97-2.12 (m, 2H), 1.79-1.86 (m, 2H).
3-348	(300 MHz, CDCl ₃) 7.34 (d, 1H), 6.90 (d, 1H), 5.84 (brm, 1H), 4.93 (brm, 1H), 4.28 (brm, 1H), 3.42-3.71 (m, 5H), 3.57 (s, 3H), 3.38 (brm, 1H), 2.86-2.96 (m, 2H), 1.81-2.01 (m, 4H), 1.22-1.31 (m, 3H).
3-349	(300 MHz, CDCl ₃) 7.33 (d, 1H), 6.89 (d, 1H), 5.83 (brm, 1H), 4.94 (brm, 1H), 4.28 (brm, 1H), 3.63-3.71 (m, 1H), 3.58 (s, 3H), 3.34-3.42 (m, 1H), 2.86-2.92 (m, 2H), 1.97-2.07 (m, 2H), 1.81-1.85 (m, 2H), 1.58-1.70 (m, 2H), 0.96-1.00 (t, 3H).
3-350	(300 MHz, CDCl ₃) 7.33 (d, 1H), 6.88 (d, 1H), 5.83 (brm, 1H), 4.93 (brm, 1H), 4.28 (brm, 1H), 3.42-3.71 (m, 5H), 3.38-3.42 (m, 1H), 2.00-2.05 (m, 2H), 1.81-1.85 (m, 2H), 1.31-1.33 (m, 6H).

[表31]

第4表のつづき

No.	¹ H-NMR δ 値ppm 測定機器: JEOL-ECX (500 MHz) 又はVARIAN Mercury plus (300 MHz)
3-351	(300 MHz, CDCl ₃) 7.33 (d, 1H), 6.89 (d, 1H), 5.80 (brm, 1H), 4.98 (br m, 1H), 4.28 (brm, 1H), 3.60-3.72 (m, 1H), 3.58 (s, 3H), 3.39-3.45 (m, 1H), 2.76-2.99 (m, 3H), 1.81-2.07 (m, 4H), 0.94-1.04 (m, 6H).
3-352	(300 MHz, CDCl ₃) 6.80-7.11 (m, 1H), 6.55-6.73 (m, 1H), 5.73-6.10 (m, 1H), 4.76-5.26 (m, 1H), 4.18-4.31 (m, 3H), 3.33-3.85 (m, 5H), 1.73-2.08 (m, 4H), 1.24-1.45 (m, 6H).
3-353	(300 MHz, CDCl ₃) 9.24 (brs, 1H), 6.92 (s, 1H), 5.07-5.09 (m, 2H), 4.18-4.20 (m, 1H), 3.86-3.93 (m, 1H), 3.62-3.66 (m, 1H), 3.48 (s, 3H), 2.26-2.28 (m, 3H), 1.78-2.20 (m, 4H).
3-354	(300 MHz, CDCl ₃) 6.95 (s, 1H), 5.37-5.45 (m, 1H), 5.01-5.27 (m, 2H), 4.25-4.29 (m, 1H), 3.52-3.57 (m, 4H), 3.25-3.33 (m, 1H), 1.97-2.18 (m, 5H), 1.68-1.86 (m, 2H), 1.26-1.36 (m, 7H).
3-355	(300 MHz, CDCl ₃) 7.01 (s, 1H), 5.68-5.87 (m, 1H), 4.89-5.04 (m, 1H), 4.26-4.31 (m, 1H), 3.55-3.66 (m, 4H), 3.33-3.38 (m, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.00-2.08 (m, 2H), 1.77-1.90 (m, 2H).
3-356	(300 MHz, CDCl ₃) 7.00 (s, 1H), 5.66-5.81 (m, 1H), 4.92-5.03 (m, 1H), 4.27-4.30 (m, 1H), 3.61-3.67 (m, 2H), 3.58 (s, 3H), 3.35-3.39 (m, 1H), 2.16 (s, 3H), 2.00-2.08 (m, 2H), 1.79-1.81 (m, 2H), 1.25-1.35 (m, 6H).
3-358	(300 MHz, CDCl ₃) 6.80-7.58 (m, 2H), 4.91-5.13 (m, 1H), 4.40-4.52 (m, 1H), 3.97-4.17 (m, 1H), 3.57-3.88 (m, 4H), 3.43 (s, 3H), 3.15-3.39 (m, 2H), 1.74-2.20 (m, 3H), 1.27-1.34 (m, 6H).
3-360	(500 MHz, acetone-d ₆) 11.70 (brs, NH), 7.46 (d, 1H), 7.11 (d, 1H), 4.71 (d, 1H), 4.50 (d, 1H), 3.87 (br, OH), 3.78 (dd, 1H), 3.71 (dd, 1H), 3.51-3.59 (m, 2H), 2.43-2.48 (m, 1H), 1.89-2.01 (m, 2H), 1.73-1.83 (m, 2H).
3-362	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.60 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 4.82 (br, 1H), 4.64 (br, 1H), 4.00-4.04 (br, OH), 3.72-3.76 (m, 1H), 3.65-3.70 (m, 1H), 3.59 (sep, 1H), 3.38-3.41 (m, 2H), 2.45-2.50 (m, 1H), 1.90-1.96 (m, 2H), 1.76-1.85 (m, 1H), 1.62-1.70 (m, 1H), 1.31 (d, 6H).
3-363	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.59 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 4.81 (d, 1H), 4.66 (brd, 1H), 4.00-4.02 (m, OH), 3.63-3.75 (m, 2H), 3.37-3.40 (m, 2H), 2.85 (brd, 2H), 2.43-2.48 (m, 1H), 1.76-1.96 (m, 4H), 1.61-1.69 (m, 1H), 0.93 (d, 6H).
3-365	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.49 (d, 1H), 6.97 (d, 1H), 5.10 (sep, 1H); 4.40-5.00 (br, 2H), 3.64 (d, 2H), 3.30 (br, 2H), 3.28 (s, 3H), 2.49-2.54 (m, 1H), 1.87-1.98 (m, 2H), 1.70-1.79 (m, 2H), 1.30 (d, 6H).
3-368	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.49 (d, 1H), 6.97 (d, 1H), 5.10 (sep, 1H), 4.40-5.00 (br, 2H), 3.33 (br, 2H), 3.04 (dd, 1H), 2.70 (dd, 1H), 2.51-2.58 (m, 1H), 2.04-2.11 (m, 4H), 1.90-1.95 (m, 1H), 1.69-1.82 (m, 2H), 1.30 (d, 6H).
3-370	(500 MHz, acetone-d ₆) 11.91 (brs, NH), 7.46 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 4.66 (d, 1H), 4.54 (d, 1H), 3.66 (ddd, 1H), 3.59 (dd, 1H), 3.50 (dd, 1H), 3.34 (dd, 1H), 2.32-2.45 (m, 2H), 2.01-2.09 (m, 1H), 1.82-1.87 (m, 1H), 1.49-1.57 (m, 1H).
3-372	(500 MHz, acetone-d ₆) 7.59 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 4.50-4.95 (brm, 2H), 3.44-3.61 (m, 4H), 3.15-3.20 (m, 1H), 2.31-2.44 (m, 2H), 2.00-2.08 (m, 1H), 1.87-1.92 (m, 1H), 1.50-1.59 (m, 1H), 1.31 (br, 6H).

1/300,000ヘクタールポットに畑作土壌をつめ、各種植物（イヌビエ(barnyardgrass(Echinochloacrus-galli L.)), メヒシバ(crabgrass (Digitaria sanguinalis L.)), エノコログサ(green foxtail (Setariaviridis L.)), アオゲイトウ(redroot pigweed (Amaranthusretroflexus L.)), アメリカキンゴジカ(prickly sida (Sidaspinosa L.)), イチビ(velvetleaf (Abutilon theophrastiMEDIC.))) の種子を播種した。播種翌日、本発明に係る化合物を通常の製剤方法に準じて調製した水和剤又は乳剤を所定の有効成分量となるように秤量し、1ヘクタール当り1,000リットル相当の水に希釈し、小型スプレーで土壌処理した。

[0212] 薬剤処理後、14～21日目に各種植物の生育状態を肉眼で観察し、0（無処理区と同等）～100（完全枯殺）の生育抑制率（％）で除草効果を評価し、第5表の結果を得た。

[0213] [表32]

第5表

化合物 No.	有効成分量 g/ha	生育抑制率（％）					
		イヌビエ	メヒシバ	エノコログサ	アオゲイトウ	アメリカキンゴジカ	イチビ
1-73	1000	90	95	90	0	50	0
1-79	1000	100	100	100	50	30	0
1-80	1000	70	95	70	0	30	0
1-87	1000	95	98	90	0	30	0
1-99	1000	90	100	100	70	30	20
1-102	1000	90	95	99	0	0	0
1-121	1000	99	98	85	50	50	30
1-124	1000	95	80	50	0	0	0
2-3	500	90	0	30	0	0	0
2-5	500	80	0	30	0	30	0
2-9	500	100	0	30	50	20	0

[0214] ・試験例2

1/170,000ヘクタールポットに畑作土壌をつめ、各種植物（イヌビエ(barnyardgrass(Echinochloacrus-galli L.)), メヒシバ(crabgrass (Digitaria sanguinalis L.)), エノコログサ(green foxtail (Setariaviridis L.)), アオゲイトウ(redroot pigweed (Amaranthusretroflexus L.)), アメリカキンゴジカ(prickly sida (Sidaspinosa L.)), イチビ(velvetleaf (Abutilon theophrastiMEDIC.))) の種子を播種した。播種翌日、本発明に係る化合物を通常の製剤方法に準じて調製した水和剤又は乳剤を所定の有効成分量となるように秤量し、1ヘクタール当り1,000リットル相当の水に希釈し、小型スプレーで土壌処理した。

nguinalis L.)), エノコログサ(green foxtail (Setaria viridis L.)), アオゲイトウ(redroot pigweed (Amaranthus retroflexus L.)), アメリカキンゴジカ(prickly sida (Sida spinosa L.)), イチビ(velvetleaf (Abutilon theophrasti MEDIC.)), イネ(rice (Oryza sativa L.)), トウモロコシ(corn (Zea mays L.)), コムギ(wheat (Triticum spp.)), ワタ(cotton (Gossypium spp.)), ダイズ(soybean (Glycine max Merr.)) の種子を播種した。播種翌日、本発明に係る化合物を通常の製剤方法に準じて調製した水和剤又は乳剤を所定の有効成分量となるように秤量し、1ヘクタール当り500リットル相当の水に希釈し、小型スプレーで土壌処理した。

[0215] 薬剤処理後、14～21日目に各種植物の生育状態を肉眼で観察し、0（無処理区と同等）～100（完全枯殺）の生育抑制率（％）で除草効果を評価し、第6表の結果を得た。

[0216]

[表33]

第6表

化合物	有効成分量	生育抑制率 (%)										
		イヌビエ	メヒシバ	エノコログサ	アオゲイトウ	キンゴジカ	イチビ	イネ	トウモロコシ	コムギ	ワタ	ダイズ
No.	g/ha											
1-1	250	90	20	90	0	0	0	50	0	-	0	0
1-3	250	70	100	98	30	70	50	40	70	20	-	0
1-5	250	90	0	70	0	50	0	0	0	0	-	20
1-7	250	80	0	30	0	0	0	0	0	0	-	0
1-56	250	90	0	50	0	0	0	50	0	-	0	0
1-58	250	99	0	70	0	0	0	20	0	-	0	0
1-69	250	98	80	50	0	30	0	80	50	-	0	0
1-71	250	90	80	50	30	30	0	50	50	-	0	0
1-78	250	50	90	70	30	50	0	10	0	20	-	0
1-112	250	95	0	0	98	70	50	30	0	-	0	0
1-113	250	95	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0
1-114	250	85	0	30	0	0	0	20	0	-	0	0
1-147	500	90	60	40	30	0	20	40	0	-	0	0
1-160	250	100	99	99	50	30	50	70	80	20	-	0
1-163	125	80	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0
1-169	250	90	90	30	0	0	0	0	0	-	0	0
1-171	125	90	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0
1-173	63	50	90	70	30	50	0	20	30	0	-	0
1-180	500	70	80	90	30	0	0	100	95	100	-	30
1-181	500	80	85	90	0	0	0	98	40	50	-	0
1-184	500	100	98	100	60	40	50	100	70	50	-	0
1-185	500	99	85	95	0	40	0	0	50	0	-	0
1-188	500	98	85	90	0	30	0	95	0	40	-	0
3-1	250	30	0	95	50	30	50	0	0	40	-	-
3-3	250	70	50	98	20	30	50	40	40	40	-	-
3-4	250	95	100	98	90	70	90	95	70	30	-	0
3-6	500	70	30	85	30	50	50	50	95	-	0	0
3-14	250	70	98	95	50	70	70	40	70	50	-	0
3-25	250	98	80	95	50	30	20	30	40	-	0	0
3-73	500	100	98	99	50	50	50	100	90	20	-	0
3-89	250	30	0	80	0	30	20	0	0	0	-	0
3-235	500	95	90	95	70	30	30	100	80	-	30	0
3-236	500	100	100	99	80	70	30	100	99	-	10	0
3-237	500	99	98	98	60	20	0	100	80	-	0	0
3-241	500	99	98	100	70	70	50	100	100	-	20	0
3-259	500	80	20	70	0	0	0	0	20	-	0	0
3-284	500	70	50	80	30	30	0	40	40	-	30	0

[0217]

[表34]

第6表つづき

化合物	有効成分量	生育抑制率 (%)										
		イヌビエ	メヒシバ	エノコログサ	アオゲイトウ	アメリカキンゴジカ	イチビ	イネ	トウモロコシ	コムギ	ワタ	ダイズ
No.	g/ha											
3-286	500	98	95	70	40	30	0	70	40	-	0	0
3-287	500	99	98	90	30	20	0	90	50	-	20	0
3-288	500	98	75	40	30	0	0	0	0	-	10	0
3-289	500	95	90	80	0	30	0	70	40	-	0	0
3-290	500	99	99	99	80	70	30	100	98	-	0	0
3-291	500	90	98	98	70	50	0	100	95	-	20	0
3-292	500	99	99	100	80	50	0	100	99	-	0	20
3-293	500	100	100	100	90	85	80	100	95	100	-	0
3-294	500	100	100	100	85	50	20	100	95	90	-	0
3-295	500	99	99	98	40	30	0	80	20	0	-	0
3-299	500	100	100	100	90	85	70	98	98	100	-	-
3-300	500	100	100	99	80	80	70	90	95	80	-	0
3-301	500	100	95	90	20	40	0	0	50	0	-	0
3-304	500	95	70	30	20	50	30	0	0	0	-	0
3-305	500	95	98	70	50	50	30	50	70	40	-	0
3-309	500	50	98	0	30	30	30	0	0	0	-	0
3-310	500	80	90	0	50	30	50	0	40	20	-	0
3-311	500	20	75	80	50	30	70	40	70	40	-	0
3-333	500	90	90	70	20	0	0	10	40	0	-	0
3-341	500	90	95	95	50	-	30	90	70	70	-	0
3-342	500	80	20	0	0	0	0	0	10	0	-	0
3-345	125	100	98	70	20	-	0	50	50	80	-	0
3-346	500	99	99	90	50	70	0	100	50	-	0	0
3-347	125	70	95	50	0	-	0	0	20	0	-	0
3-348	500	98	98	80	20	-	0	100	80	30	-	10
3-349	500	80	95	90	20	-	0	70	50	0	-	0
3-350	500	98	95	30	20	30	0	50	-	-	0	0
3-365	500	75	20	80	0	0	10	0	0	-	30	0

[0218] ・試験例3

1/1,000,000ヘクタールポットに水田土壌を詰め、タイヌビエ(*barnyardgrass* (*Echinochloa oryzicola* vasing.))及びホタルイ(Japanese bulrush (*Scirpus juncoides*))の種子を播種し、その上に軽く覆土した。その後、湛水深0.5~1cmの状態です温室内に静置し、翌日にウリカワ(Japanese ribbon waparo (*Sagittaria pygmaea*))の塊茎を植えた。その後、湛水深を3~4cmに保ち、タイヌビエ及びホタルイが0.5葉期、ウリカワが初生葉期に達した時点で、本発明に係る化合物を通常の製剤方法に準じて調製した水和剤又は乳剤の

水希釈液を、所定の有効成分量になるようにピペットで均一に滴下処理した。また、1/1,000,000ヘクターポットに水田土壌を詰め、代かきを行い、湛水深を3~4cmとし、翌日に2葉期のイネ(rice (Oryza sativa L.)) (品種：日本晴)を移植深3cmに移植した。移植翌日に本発明に係る化合物を前述と同様に処理した。

[0219] 薬剤処理後、10~19日目にタイヌビエ、ホタルイ及びウリカワの生育状態を、また薬剤処理後、12~21日目にイネの生育状態を各々肉眼で観察し、0（無処理区と同等）~100（完全枯殺）の生育抑制率（%）で評価し、第7表の結果を得た。

[0220]

[表35]

第7表

化合物	有効成分量	生育抑制率 (%)			
		タイヌビエ	ホタルイ	ウリカワ	イネ
No.	g/ha				
1-1	63	90	60	0	0
1-3	63	-	0	-	0
	16	90	-	-	-
1-5	63	-	100	60	0
	32	95	-	-	-
1-7	63	-	95	0	10
	32	100	-	-	-
1-56	63	-	-	-	20
1-58	63	-	60	20	0
	32	80	-	-	-
1-71	63	-	80	0	20
	32	100	-	-	-
1-73	63	-	80	0	10
	32	90	-	-	-
1-77	63	-	-	-	0
	32	90	80	0	-
1-78	63	-	0	0	0
	32	80	-	-	-
1-79	63	-	-	-	0
	32	0	0	40	-
1-80	63	-	-	-	0
	32	100	0	0	-
1-88	63	-	80	0	0
	32	20	-	-	-
1-99	63	-	-	-	0
1-102	63	-	60	0	0
	32	100	-	-	-
1-112	63	-	-	-	40
1-113	63	-	100	0	20
	32	80	-	-	-
1-114	63	-	100	0	10
	32	70	-	-	-

[0221]

[表36]

第7表つづき

化合物 No.	有効成分量 g/ha	生育抑制率 (%)			
		タイヌビエ	ホタルイ	ウリカワ	イネ
1-121	63	—	—	—	0
1-124	63	—	70	0	0
	32	100	—	—	—
1-147	63	—	95	30	—
	32	90	93	30	—
1-160	63	—	70	10	0
	32	60	—	—	—
1-163	63	—	—	—	0
	32	85	0	0	—
1-171	63	—	—	—	0
	16	100	0	0	—
1-172	63	—	80	40	0
	32	100	—	—	—
1-173	63	—	80	0	50
	32	95	—	—	—
1-176	63	70	0	60	0
	32	10	0	0	0
1-178	63	93	0	70	0
	32	70	0	0	—
1-184	63	95	40	75	0
	32	93	30	85	0
1-185	63	98	65	70	0
	32	88	0	40	0
1-186	63	90	70	—	—
	32	88	30	70	—
1-188	63	95	0	70	0
	32	78	0	—	0
2-1	63	—	—	—	0
2-3	63	—	—	—	0
2-5	63	—	90	60	10
	32	90	—	—	—
2-7	63	—	20	0	0
	32	90	—	—	—
2-8	63	—	0	0	0
	32	10	—	—	—
2-9	63	—	0	0	30
	32	10	—	—	—
2-10	63	—	0	0	0
	32	10	—	—	—

[0222]

[表37]

第7表つづき

化合物 No.	有効成分量 g/ha	生育抑制率 (%)			
		タ イ ヌ ビ エ	ホ タ ル イ	ウ リ カ ワ	イ ネ
3-1	63	-	-	-	0
3-3	63	-	95	95	40
	32	95	-	-	-
3-4	63	-	95	90	50
	32	100	-	-	-
3-6	63	100	100	40	0
	32	100	80	20	-
3-12	63	-	95	90	0
	32	95	-	-	-
3-14	63	-	50	10	20
	32	40	-	-	-
3-25	63	-	100	70	20
	32	90	-	-	-
3-41	63	-	40	0	20
	32	0	-	-	-
3-73	63	-	98	70	0
	32	60	-	-	-
3-89	63	-	98	20	0
	32	0	-	-	-
3-105	63	-	98	0	0
	32	10	-	-	-
3-199	63	100	95	10	30
	32	100	-	-	-
3-207-1	63	99	100	0	0
	32	60	100	0	-
3-207-2	63	100	90	0	10
	32	50	70	0	-
3-237	63	98	99	0	8
	32	65	95	0	-
3-241	63	-	100	0	40
	32	95	-	-	-
3-259	63	70	98	65	0
	32	65	98	20	-
3-278	63	85	100	0	0
	32	80	90	0	-
3-281	63	100	80	0	0
	32	0	20	0	-

[0223]

[表38]

第7表つづき

化合物 No.	有効成分量 g/ha	生育抑制率 (%)			
		タイヌビエ	ホタルイ	ウリカワ	イネ
3-284	63	100	100	0	0
	32	90	80	0	—
3-286	63	99	99	85	8
	32	97	93	75	—
3-287	63	—	99	0	18
	32	100	—	—	—
3-288	63	99	99	65	10
	32	97	78	20	—
3-289	63	—	93	50	0
	32	100	—	—	—
3-290	63	—	60	0	5
	32	0	—	—	—
3-291	63	—	65	30	0
	32	75	—	—	—
3-292	63	—	60	30	25
	32	75	—	—	—
3-293	63	88	0	0	15
	32	50	0	0	—
3-294	63	97	20	65	15
	32	30	0	0	—
3-295	63	93	30	50	15
	32	30	0	30	—
3-297	63	95	30	65	30
	32	93	0	0	0
3-299	63	60	0	0	13
	32	0	0	0	—
3-300	63	90	40	0	0
	32	20	20	0	—
3-301	63	93	0	70	—
	32	30	0	0	—
3-304	63	93	95	0	0
	32	0	83	0	—

[0224]

[表39]

第7表つづき

化合物 No.	有効成分量 g/ha	生育抑制率 (%)			
		タイヌビエ	ホタルイ	ウリカワ	イネ
3-305	63	78	0	0	0
	32	40	0	0	—
3-306	63	99	40	50	0
	32	20	0	0	—
3-307	63	93	20	60	0
	32	60	0	0	—
3-308	63	98	99	0	0
	32	30	60	0	—
3-309	63	75	90	60	0
	32	30	65	0	—
3-310	63	90	70	0	0
	32	90	65	0	—
3-312	63	97	20	0	0
	32	20	0	0	—
3-315	63	99	40	70	0
	32	85	0	30	0
3-316	63	99	30	30	30
	32	97	0	0	0
3-325	63	30	97	0	0
	32	0	30	0	—
3-327	63	98	65	0	0
	32	98	0	0	0
3-328	63	98	65	40	0
	32	93	0	0	0
3-330	63	98	60	0	0
	32	95	0	0	0
3-333	63	97	70	68	0
	32	80	65	70	0
3-337	63	50	20	0	0
	32	0	0	0	—
3-338	63	80	0	0	0
	32	0	0	0	—
3-340	63	98	0	40	10
	32	80	0	—	—

[0225]

[表40]

第7表つづき

化合物 No.	有効成分量 g/ha	生育抑制率 (%)			
		タイヌビエ	ホタルイ	ウリカワ	イネ
3-342	63	88	0	0	0
	32	70	0	0	—
3-343	63	88	0	65	0
	32	50	0	60	—
3-346	63	97	90	60	0
	32	68	40	30	—
3-347	63	—	0	88	15
	32	40	—	—	—
3-348	63	93	0	60	40
	32	50	0	20	—
3-349	63	97	0	50	5
	32	97	0	0	—
3-350	63	—	85	20	0
	32	90	—	—	—
3-351	63	99	0	—	15
	32	99	0	60	—
3-352	63	99	0	75	5
	32	99	0	30	—
3-354	63	65	0	0	0
	32	50	0	0	—
3-358	63	98	60	70	0
	32	83	0	50	0
3-362	63	—	50	0	0
	32	90	—	—	—
3-363	63	—	0	0	0
	32	90	—	—	—
3-365	63	93	97	0	0
	32	70	93	0	—

[0226] ・試験例4

1/170,000ヘクタールポットに畑作土壌をつめ、各種植物の種子を播種した。その後、植物が一定の葉令（（1）イヌビエ(*Echinochloa crus-galli* L.)）；0.5～3.0葉期、（2）メヒシバ(*Digitaria sanguinalis* L.)）；0.5～3.0葉期、（3）エノコログサ(*Setaria viridis* L.)）；1.5～3.5葉期、（4）アオゲイトウ(*Amaranthus retroflexus* L.)）；0.2～2.5葉期、（5）アメリカキンゴジカ(p

rickly sida (Sida spinosa L.)); 子葉～2.0葉期、(6) イチビ(velvetleaf (Abutilon theophrasti MEDIC.)); 0.2～2.0葉期、(7) イネ(rice (Oryza sativa L.)); 1.0～2.5葉期、(8) トウモロコシ(corn (Zea mays L.)); 2.0～3.5葉期、(9) コムギ(wheat (Triticum spp.)); 2.0～3.5葉期、(10) ワタ(cotton (Gossypium spp.)); 初生葉～1.0葉期、(11) ダイズ(soybean (Glycine max Merr.)); 初生葉～0.5葉期) に達したとき、本発明に係る化合物を通常の製剤方法に準じて調製した水和剤又は乳剤を所定の有効成分量となるように秤量し、1ヘクタール当り500リットル相当の水(農業用展着剤(クサリノー: 日本農薬株式会社製)を0.1容量%含有)に希釈した。調製した散布液を小型スプレーで茎葉処理した。

[0227] 薬剤処理後、14～21日目に各種植物の生育状態を肉眼観察し、0(無処理区と同等)～100(完全枯殺)の生育抑制率(%)で除草効果を評価し、第8表の結果を得た。

[0228] [表41]

第8表

化合物	有効成分量	生育抑制率 (%)										
		イヌビエ	メヒシバ	エノコログサ	アオゲイトウ	キンゴジカ	イチビ	イネ	トウモロコシ	コムギ	ワタ	ダイズ
No.	g/ha											
1-3	500	70	80	50	0	50	80	70	70	30	-	70
1-5	500	90	40	20	0	50	50	0	0	0	-	30
1-7	500	80	0	30	0	30	50	30	20	0	-	40
1-56	500	90	50	50	0	10	40	0	20	0	-	30
1-58	500	90	50	50	0	20	50	10	0	0	-	40
1-69	500	90	70	50	20	30	40	0	80	10	-	50
1-73	500	90	70	50	20	20	40	10	70	0	-	40
1-78	500	90	40	0	0	0	30	0	40	0	-	50
1-99	500	90	40	50	0	0	20	20	0	0	-	40
1-102	500	90	80	50	20	20	30	50	70	20	-	40
1-114	500	90	0	0	0	0	50	0	0	0	-	40
1-121	500	85	40	0	0	0	30	0	50	0	-	40
1-124	500	90	40	0	30	0	30	0	70	0	-	50
1-160	500	90	40	30	0	50	30	40	0	20	-	40
1-163	500	90	80	30	0	50	50	70	50	40	-	10
1-171	500	90	70	50	30	50	50	40	0	0	-	40
1-173	500	90	70	50	30	50	50	70	80	0	-	50
1-176	500	80	75	70	20	70	50	20	70	0	-	70

[0229] [表42]

第 8 表 つづき												
化合物	有効成分量	生育抑制率 (%)										
		イヌビエ	メヒシバ	エノコログサ	アオゲイトウ	キンゴジカ	イチビ	イネ	トウモロコシ	コムギ	ワタ	ダイズ
No.	g/ha											
3-1	500	90	30	30	20	50	70	10	70	-	50	40
3-3	500	90	70	70	50	80	80	50	80	-	50	50
3-4	500	90	30	50	30	85	70	50	80	-	30	40
3-12	500	90	70	70	40	80	80	20	80	-	50	50
3-14	500	80	0	30	0	70	70	0	40	-	40	40
3-25	500	85	30	30	30	80	70	40	80	-	40	40
3-41	500	80	0	20	75	40	50	0	0	-	50	50
3-73	500	80	70	50	30	90	80	40	70	-	50	50
3-89	500	95	0	40	50	70	80	50	70	-	50	50
3-105	500	90	0	30	30	70	70	0	80	-	50	50
3-235	500	95	85	50	40	60	75	70	80	-	20	50
3-236	500	95	90	70	30	70	75	70	80	-	50	50
3-237	500	-	90	80	30	70	70	50	80	-	20	50
3-278	500	90	30	70	0	-	85	50	40	0	-	70
3-281	500	90	70	80	30	-	-	50	80	50	-	70
3-286	500	95	90	70	50	75	80	70	80	-	40	50
3-287	500	98	90	70	50	-	75	70	80	-	50	50
3-288	500	98	90	75	40	70	75	70	80	-	50	50
3-302	500	-	30	0	30	70	80	50	50	-	30	50
3-304	500	-	85	40	20	75	80	40	50	-	40	40
3-305	500	80	70	70	0	-	80	50	60	10	-	70
3-308	500	95	80	70	40	70	80	50	70	-	50	50
3-309	500	90	70	70	20	-	95	30	70	0	-	80
3-310	500	90	70	70	30	-	90	10	30	0	-	70
3-360	500	90	50	50	30	70	40	40	30	0	-	70
3-361	500	90	50	70	40	70	40	30	40	0	-	70
3-362	500	80	40	70	30	-	40	30	40	0	-	50
3-365	500	-	75	50	20	50	80	50	80	-	30	40
3-368	500	80	0	50	20	40	80	40	70	-	30	40

[0230] 次に、本発明の製剤例を記載する。

[0231] ・製剤例 1

- (1) 本発明化合物 75 重量部
- (2) ゲロポン T-77 (商品名; ローヌ・プーラン社製) 14.5 重量部
- (3) NaCl 10 重量部

量部

(4) デキストリン 0.5 重量部

量部

以上の(1)～(4)の各成分を高速混合細粒機に入れ、さらにそこへ20%の水を加え造粒、乾燥することにより顆粒水和剤が得られる。

[0232] ・製剤例2

(1) カオリン 78 重量部

(2) ラベリンFAN (商品名；第一工業製薬(株)製) 2 重量部

(3) ソルポール5039 (商品名；東邦化学工業(株)製) 5 重量部

(4) カープレックス (商品名；DSLジャパン(株)製) 15 重量部

以上の(1)～(4)の成分の混合物と本発明化合物とを9：1の重量割合で混合することにより水和剤が得られる。

[0233] ・製剤例3

(1) ハイフィラーNo. 10 (商品名；松村産業(株)製) 33 重量部

(2) ソルポール5050 (商品名；東邦化学工業(株)製) 3 重量部

(3) ソルポール5073 (商品名；東邦化学工業(株)製) 4 重量部

(4) 本発明化合物 60 重量部

以上の(1)～(4)の各成分を混合することにより水和剤が得られる。

[0234] ・製剤例4

(1) 本発明化合物 4 重量部

(2) ベントナイト 30 重量部

(3) 炭酸カルシウム 61.5

重量部

(4) トキサノン GR-31A (商品名; 三洋化成工業 (株) 製) 3

重量部

(5) リグニンスルホン酸カルシウム塩 1.5

重量部

予め粉碎した (1) と、(2) 及び (3) とを混合し、そこへ (4)、(5) 及び水を加えて混合し、押出造粒する。その後、乾燥、整粒することにより粒剤が得られる。

[0235] ・製剤例 5

(1) 本発明化合物 30 重量部

(2) ジークライト (商品名; ジークライト (株) 製) 60 重量部

(3) ニューカルゲン WG-1 (商品名; 竹本油脂 (株) 製) 5 重量部

(4) ニューカルゲン FS-7 (商品名; 竹本油脂 (株) 製) 5 重量部

上記 (1)、(2) 及び (3) を混合し、粉碎機を通した後、(4) を加えて混練後、押出造粒する。その後、乾燥、整粒することにより顆粒水和剤が得られる。

[0236] ・製剤例 6

(1) 本発明化合物 28 重量部

(2) ソプロポール FL (商品名; ローヌ・プーラン社製) 2 重量部

(3) ソルポール 355 (商品名; 東邦化学工業 (株) 製) 1 重量部

(4) IP ソルベント 1620 (商品名; 出光石油化学 (株) 製) 32

重量部

(5) エチレングリコール

6

重量部

(6) 水

3 1

重量部

以上の(1)～(6)の各成分を混合し、湿式粉碎機(ダイノミル)を用いて粉碎することにより水性懸濁剤が得られる。

[0237] 本発明は上述した各実施形態に限定されるものではなく、請求項に示した範囲で種々の変更が可能であり、異なる実施形態にそれぞれ開示された技術的手段を適宜組み合わせて得られる実施形態についても本発明の技術的範囲に含まれる。さらに、各実施形態にそれぞれ開示された技術的手段を組み合わせることにより、新しい技術的特徴を形成することができる。

産業上の利用可能性

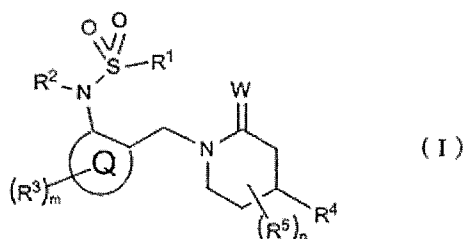
[0238] 本発明化合物は、類似する従来化合物に比して望ましくない植物への著しい除草活性の向上を実現する。また、作物への高い安全性を有する。それゆえ、本発明に係るヘテロアリールスルホンアミド系化合物又はその塩は、除草剤の有効成分として使用した場合に、優れた除草効果を示す。その適用範囲は、水田、畑地、果樹園、桑園などの農耕地、山林、農道、グラウンド、工場敷地などの非農耕地と多岐にわたり、適用方法も土壌処理、茎葉処理、湛水処理などを適宜選択できる。

[0239] なお、2013年4月23日に出願された日本国特許出願2013-090755号の明細書、特許請求の範囲、及び要約書の全内容をここに引用し、本発明の明細書の開示として、取り入れるものである。

請求の範囲

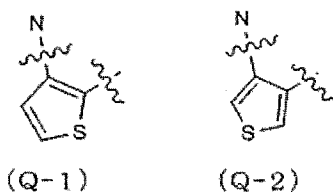
[請求項1] 一般式 (I) :

[化1]



〔式中、Qは一般式 (Q-1) 又は一般式 (Q-2) :

[化2]



で表されるチオフェン環であり；Wは酸素原子又は硫黄原子であり；mは0～2の整数であり；nは0～7の整数であり；R¹はハロC₁-C₆アルキルであり；R²は水素原子、C₁-C₁₂アルコキシカルボニル、C₁-C₁₂アルキルカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルカルボニル、シクロC₃-C₆アルキルカルボニル、シクロC₃-C₆アルキルC₁-C₆アルキルカルボニル、C₂-C₆アルケニルカルボニル、Yで置換されてもよいフェニルC₂-C₆アルケニルカルボニル、Yで置換されてもよいフェニルカルボニル、Yで置換されてもよい複素環カルボニル、ハロC₁-C₁₂アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルで置換されてもよいシクロC₃-C₆アルコキシカルボニル、C₂-C₆アルケニルオキシカルボニル、ハロC₂-C₆アルケニルオキシカルボニル、C₂-C₆アルキニルオキシカルボニル、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₆アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルホルニルC₁-C₆アルコキシカルボニル、Yで置換されてもよいフェニルC₁-C₆アルコキシカルボニル、Yで置換されてもよいフェニルハロC₁-C₆

アルコキシカルボニル、Yで置換されてもよいフェノキシカルボニル、Yで置換されてもよいフェノキシC₁-C₆アルコキシカルボニル、C₁-C₆アルキルチオカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルチオカルボニル、モノC₁-C₆アルキルアミノカルボニル、モノ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノカルボニル、窒素原子上の2つのC₁-C₆アルキルが互いに結合して3～8員環を形成してもよいジC₁-C₆アルキルアミノカルボニル、ジ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノカルボニル、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルコシオキサリル、C₁-C₆アルキルスルホニル、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル、Yで置換されてもよいフェニルスルホニル、Yで置換されてもよい複素環スルホニル、シクロC₃-C₆アルキルスルホニル、C₁-C₆アルキル、ハロC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよいフェニルC₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₁-C₆アルキルカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、シクロC₃-C₆アルキルカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよいフェニルカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよい複素環カルボニルオキシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、シクロC₃-C₆アルコキシカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよいフェノキシカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、モノC₁-C₆アルキルアミノカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、窒素原子上の2つのC₁-C₆アルキルが互いに結合して3～8員環を形成してもよいジC₁-C₆アルキルアミノカルボニルオキシC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよいフェニルアミノカルボニルオキシC₁-C₆アルキル又はYで置換されてもよいN-C₁-C₆アルキル-N-フェニルアミノカルボニルオキシC₁-C₆アルキルであり；R³はハロゲン原子又はC₁-C₆アルキルであり；R⁴は水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₁-C₆アルキルで置換されてもよいC₃-C₆シクロアルキル、ハロC₁-C₆アルキル、ハロC₃-C₆シクロアルキル、C₃-C₆シクロアルキルC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよい

フェニル、Yで置換されてもよいフェニルC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルカルボニルオキシ、水酸基、C₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルコキシ、C₃-C₆アルケニルオキシ、C₃-C₆アルキニルオキシ、C₁-C₆アルキルチオ、ハロC₁-C₆アルキルチオ、C₁-C₆アルキルスルフィニル、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル、C₁-C₆アルキルスルホニル、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル、Yで置換されてもよいフェノキシ、Yで置換されてもよいフェニルチオ、Yで置換されてもよいフェニルスルフィニル、Yで置換されてもよいフェニルスルホニル、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₆アルコキシ、ヒドロキシC₁-C₆アルコキシ、モノ (C₁-C₆アルキル) アミノC₁-C₆アルコキシ、窒素原子上の2つのC₁-C₆アルキルが互いに結合して3~8員環を形成してもよいジ (C₁-C₆アルキル) アミノC₁-C₆アルコキシ、Yで置換されてもよいフェノキシC₁-C₆アルコキシ、Yで置換されてもよいフェニルC₁-C₆アルコキシ、Yで置換されてもよいフェニルC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシ、シアノC₁-C₆アルコキシ、ニトロC₁-C₆アルコキシ、(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル) オキシ又は(テトラヒドロフラン-2-イル) オキシであり；R⁵は水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₁-C₆アルキルで置換されてもよいC₃-C₆シクロアルキル、ハロC₁-C₆アルキル、ハロC₃-C₆シクロアルキル、C₃-C₆シクロアルキルC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよいフェニル、Yで置換されてもよいフェニルC₁-C₆アルキル、ヒドロキシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルカルボニルオキシ、水酸基、C₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルチオ、ハロC₁-C₆アルキルチオ、C₁-C₆アルキルスルフィニル、C₁-C₆アルキルスルホニル、ハロC₁-C₆アルキルスル

フィニル又はハロC₁-C₆アルキルスルホニルであり；mが2の場合、複数のR³はおのこの同一でも相異なってもよく；R⁵はピペリジン環上にn個置換してもよく、nが2以上の場合、複数のR⁵はおのこの同一でも相異なってもよく、また同一の炭素上に置換してもよく；R⁴又はR⁵は、それらが結合する炭素原子と同一の炭素原子上のR⁵と結合し、オレフィン又はカルボニルを形成することができ；R⁴又はR⁵は、それらが結合する炭素原子と隣り合った炭素原子上の任意のR⁴又はR⁵と結合し二重結合を形成することができ；ただし、Qが一般式（Q-1）で表されるチオフェン環のとき、R⁴又はR⁵のうち少なくとも1つは、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₁-C₆アルキルで置換されてもよいC₃-C₆シクロアルキル、ハロC₁-C₆アルキル、ハロC₃-C₆シクロアルキル、C₃-C₆シクロアルキルC₁-C₆アルキル、Yで置換されてもよいフェニル、Yで置換されてもよいフェニルC₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルキルカルボニルオキシ又は水酸基以外の置換基であり；Yはハロゲン原子、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、C₁-C₆アルキルで置換されてもよいC₃-C₆シクロアルキル、ハロC₁-C₆アルキル、ハロC₂-C₆アルケニル、ハロC₂-C₆アルキニル、ハロC₃-C₆シクロアルキル、C₁-C₆アルコキシ、ハロC₁-C₆アルコキシ、C₁-C₆アルキルチオ、ハロC₁-C₆アルキルチオ、C₁-C₆アルキルスルフィニル、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル、C₁-C₆アルキルスルホニル、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル、カルボキシル、C₁-C₆アルキルカルボニル、ハロC₁-C₆アルキルカルボニル、C₁-C₆アルコキシカルボニル、ハロC₁-C₆アルコキシカルボニル、アミノ、モノ（C₁-C₆アルキル）アミノ、モノ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノ、ジ（C₁-C₆アルキル）アミノ、ジ（ハロC₁-C₆アルキル）アミノ、シアノ、ニトロ又は水酸基であり；前記複素環は、チエニル、フリル、ピロリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、イソオキサゾリニル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル

、1,3,4-チアジア

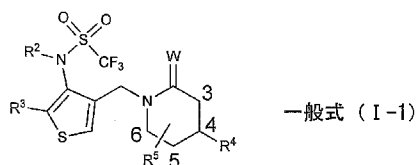
ゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、1,2,3-トリアゾリル、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,3,4-テトラゾリル、ピリジル、ピリミジル、ピラジニル、ピリダジニル、1,3,5-トリアジニル、1,2,4-トリアジニル、ベンゾチエニル、ベンゾフリル、インドリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイソチアゾリル、インダゾリル、ベンゾオキサゾリル、キノリル、イソキノリル、キノキサリニル、フタラジニル、シンノリニル、キナゾリニル、イミダゾリニル、イミダゾリジニル、ピラゾリニル又はピラゾリジニルである]

で表されるヘテロアリールスルホンアミド系化合物又はその塩。

[請求項2]

一般式 (I-1) :

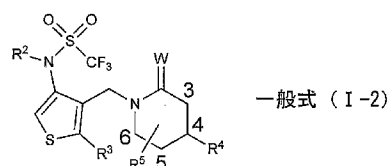
[化3]



[式中のW、R²~R⁵は前記と同じ]、

一般式 (I-2) :

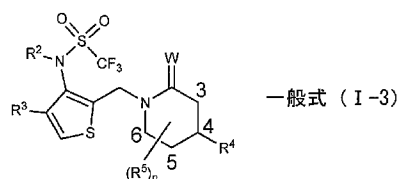
[化4]



[式中のW、R²~R⁵は前記と同じ]、

又は、一般式 (I-3) :

[化5]

〔式中のW、n、R²～R⁵は前記と同じ〕

で表される請求項1に記載のヘテロアリールスルホンアミド系化合物又はその塩。

[請求項3] 請求項1又は2に記載のヘテロアリールスルホンアミド系化合物又はその塩を有効成分として含有する除草剤。

[請求項4] 請求項1又は2に記載のヘテロアリールスルホンアミド系化合物又はその塩の除草有効量を、望ましくない植物又はそれが生育する場所に施用し、当該望ましくない植物を防除又はその生育を抑制する方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2014/061143

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D409/06(2006.01)i, A01N47/04(2006.01)i, A01P13/02(2006.01)i,
C07D409/14(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)

C07D409/06, A01N47/04, A01P13/02, C07D409/14

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

Jitsuyo Shinan Koho	1922-1996	Jitsuyo Shinan Toroku Koho	1996-2014
Kokai Jitsuyo Shinan Koho	1971-2014	Toroku Jitsuyo Shinan Koho	1994-2014

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.
Y	WO 2010/119906 A1 (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 21 October 2010 (21.10.2010), entire text & US 2012/0029187 A1 & EP 2420493 A1 & CA 2757729 A & AU 2010237801 A	1-4

☒ 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
19 June, 2014 (19.06.14)

Date of mailing of the international search report
01 July, 2014 (01.07.14)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2014/061143

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 7-501053 A (Agrevo UK Ltd.), 02 February 1995 (02.02.1995), claim 1; particularly, examples A105 to A125; example B & JP 2002-234889 A & US 5559081 A & US 5885935 A & GB 9123711 A & GB 9206458 D & GB 9206459 D & GB 9206460 D & GB 9206475 D & GB 9214400 D & GB 9123711 A0 & EP 625970 A & WO 1993/009099 A2 & DE 69222322 C & DE 69222322 D & FI 942090 A & BR 9206727 A & HU 67634 A & CA 2123093 A & AU 666681 B & IL 103635 A & ZA 9208564 A & AU 2920292 A & CZ 9401024 A & KR 10-0263409 B & RU 2266904 C	1-4
A	JP 11-515018 A (Bayer AG.), 21 December 1999 (21.12.1999), entire text & JP 4082728 B & US 6180567 B1 & US 6441195 B1 & US 2003/0162979 A1 & EP 859774 A1 & WO 1997/016449 A1 & DE 19540737 A & DE 59609032 D & DE 19540737 A1 & PL 327978 A & AU 7490996 A & BR 9611129 A & HU 9802995 A & CA 2236208 A & CN 1207099 A & CN 1439631 A	1-4
P,X	WO 2013/061973 A1 (Ishihara Sangyo Kaisha, Ltd.), 02 May 2013 (02.05.2013), entire text (Family: none)	1-4
P,Y	WO 2014/046244 A1 (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 27 March 2014 (27.03.2014), particularly, claim 12 (Family: none)	1-4

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（I P C））

Int.Cl. C07D409/06(2006.01)i, A01N47/04(2006.01)i, A01P13/02(2006.01)i, C07D409/14(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（I P C））

Int.Cl. C07D409/06, A01N47/04, A01P13/02, C07D409/14

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

日本国実用新案公報	1 9 2 2 - 1 9 9 6 年
日本国公開実用新案公報	1 9 7 1 - 2 0 1 4 年
日本国実用新案登録公報	1 9 9 6 - 2 0 1 4 年
日本国登録実用新案公報	1 9 9 4 - 2 0 1 4 年

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
Y	WO 2010/119906 A1（日産化学工業株式会社）2010. 10. 21, 全文 & US 2012/0029187 A1 & EP 2420493 A1 & CA 2757729 A & AU 2010237801 A	1-4

☒ 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

1 9 . 0 6 . 2 0 1 4

国際調査報告の発送日

0 1 . 0 7 . 2 0 1 4

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁（I S A / J P）
郵便番号 1 0 0 - 8 9 1 5
東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官（権限のある職員）

砂原 一公

4 P

4 7 6 3

電話番号 0 3 - 3 5 8 1 - 1 1 0 1 内線 3 4 9 2

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	JP 7-501053 A (アグレボ・ユー・ケイ・リミテッド) 1995. 02. 02, 請求項 1、特に、実施例 A 1 0 5 - A 1 2 5、実施例 B & JP 2002-234889 A & US 5559081 A & US 5885935 A & GB 9123711 A & GB 9206458 D & GB 9206459 D & GB 9206460 D & GB 9206475 D & GB 9214400 D & GB 9123711 A0 & EP 625970 A & WO 1993/009099 A2 & DE 69222322 C & DE 69222322 D & FI 942090 A & BR 9206727 A & HU 67634 A & CA 2123093 A & AU 666681 B & IL 103635 A & ZA 9208564 A & AU 2920292 A & CZ 9401024 A & KR 10-0263409 B & RU 2266904 C	1-4
A	JP 11-515018 A (バイエル・アクチエンゲゼルシャフト) 1999. 12. 21, 全文 & JP 4082728 B & US 6180567 B1 & US 6441195 B1 & US 2003/0162979 A1 & EP 859774 A1 & WO 1997/016449 A1 & DE 19540737 A & DE 59609032 D & DE 19540737 A1 & PL 327978 A & AU 7490996 A & BR 9611129 A & HU 9802995 A & CA 2236208 A & CN 1207099 A & CN 1439631 A	1-4
P, X	WO 2013/061973 A1 (石原産業株式会社) 2013. 05. 02, 全文 (ファミリーなし)	1-4
P, Y	WO 2014/046244 A1 (日産化学工業株式会社) 2014. 03. 27, 特に、請求項 1 2 (ファミリーなし)	1-4