(19)日本国特許庁(JP)　(12)公表特許公報(A)　(11)特許出願公表番号
特表2017-523235
(P2017-523235A)
(43)公表日　平成29年8月17日(2017.8.17)

(51)Int.Cl.		F I			テーマコード（参考）
C07D 249/14	***(2006.01)***	C07D	249/14	503	2B121
C07C 321/28	***(2006.01)***	C07C	321/28	CSP	4C056
C07C 317/44	***(2006.01)***	C07C	317/44		4H006
A01N 43/713	***(2006.01)***	A01N	43/713		4H011
A01N 43/653	***(2006.01)***	A01N	43/653	N	

審査請求 未請求　予備審査請求 未請求　（全 72 頁）　最終頁に続く

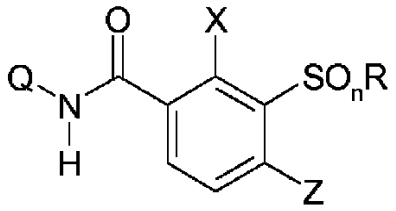
(21)出願番号　特願2017-519962 (P2017-519962)
(86)(22)出願日　平成27年6月26日 (2015.6.26)
(85)翻訳文提出日　平成29年2月22日 (2017.2.22)
(86)国際出願番号　PCT/EP2015/064484
(87)国際公開番号　WO2016/001073
(87)国際公開日　平成28年1月7日 (2016.1.7)
(31)優先権主張番号　14174873.1
(32)優先日　平成26年6月30日 (2014.6.30)
(33)優先権主張国　欧州特許庁 (EP)

(71)出願人　507203353
バイエル・クロップサイエンス・アクチェンゲゼルシャフト
ドイツ国、４０７８９・モンハイム・アム・ライン、アルフレート－ノベル－シユトラーセ・５０
(74)代理人　100114188
弁理士　小野　誠
(74)代理人　100119253
弁理士　金山　賢教
(74)代理人　100124855
弁理士　坪倉　道明
(74)代理人　100129713
弁理士　重森　一輝

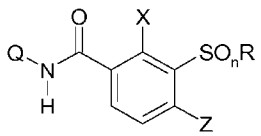
最終頁に続く

(54)【発明の名称】除草活性を有するアリールカルボン酸アミド類

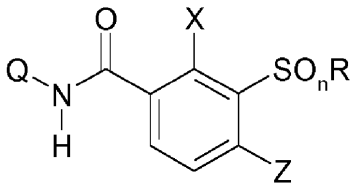
(57)【要約】
本発明は、除草剤としての、一般式（Ｉ）で表される安息香酸アミドに関する。式（Ｉ）において、Ｘ、Ｚ及びＲは、アルキル及びシクロアルキルなどのラジカルを表す。Ｑは、５員ヘテロ環を表す。


(I)

【化１】

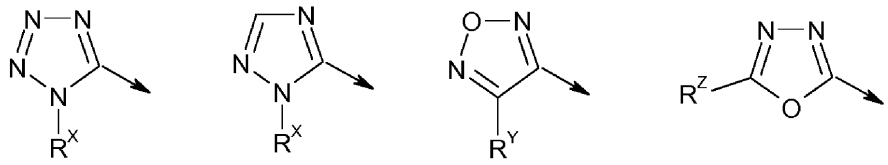

(I)

【特許請求の範囲】
【請求項１】
式（Ｉ）
【化１】



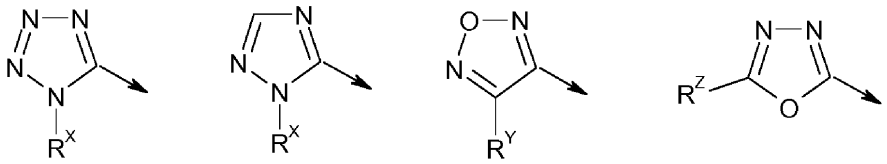
(I),

〔式中、記号及び添え字は、それぞれ、以下のように定義される：
Ｑは、Ｑ１、Ｑ２、Ｑ３又はＱ４ラジカル
【化２】



(Q1) (Q2) (Q3) (Q4)

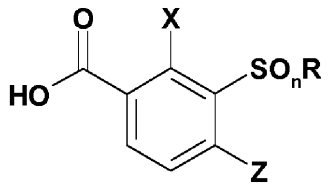
であり；
Ｘは、（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$）－アルキル又は（Ｃ$_3$－Ｃ$_6$）－シクロアルキルであり；
Ｚは、（Ｃ$_3$－Ｃ$_6$）－シクロアルキルであり；
Ｒは、（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$）－アルキル、（Ｃ$_3$－Ｃ$_6$）－シクロアルキル、（Ｃ$_3$－Ｃ$_6$）－シクロアルキル－（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$）－アルキル、（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$）－アルキル－Ｏ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$）－アルキルであり；
Ｒ^{X}は、メチル、エチル、ｎ－プロピル、プロパ－２－エン－１－イル、メトキシエチル、エトキシエチル又はメトキシエトキシエチルであり；
Ｒ^{Y}は、メチル、エチル、ｎ－プロピル、塩素又はアミノであり；
Ｒ^{Z}は、メチル、エチル、ｎ－プロピル又はメトキシメチルであり；
ｎは、０、１又は２である〕
で表されるベンズアミド又はその塩。
【請求項２】
Ｑが、Ｑ１、Ｑ２、Ｑ３又はＱ４ラジカル
【化３】



(Q1) (Q2) (Q3) (Q4)

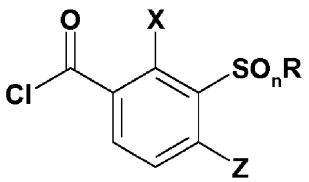
であり；
Ｘが、メチル、エチル又はシクロプロピルであり；
Ｚが、シクロプロピル又はシクロブチルであり；
Ｒが、メチル、エチル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル又はメトキシエチルであり；
Ｒ^{X}が、メチル、エチル、ｎ－プロピル、プロパ－２－エン－１－イル、メトキシエチル、エトキシエチル又はメトキシエトキシエチルであり；
Ｒ^{Y}が、メチル、エチル、ｎ－プロピル、塩素又はアミノであり；

R^Zが、メチル、エチル、ｎ－プロピル又はメトキシメチルであり；
ｎが、０、１又は２である；
請求項１に記載のベンズアミド。
【請求項３】
除草剤組成物であって、除草活性を示す含有量の請求項１及び２のいずれかに記載の式（Ｉ）で表される少なくとも１種類の化合物を特徴とする、前記除草剤組成物。
【請求項４】
製剤助剤と混合されている、請求項３に記載の除草剤組成物。
【請求項５】
望ましくない植物を防除する方法であって、有効量の請求項１若しくは２に記載の式（Ｉ）で表される少なくとも１種類の化合物又は請求項３若しくは４に記載の除草剤組成物を、当該植物に施用すること又は当該望ましくない植生の生育環境に施用することを特徴とする、前記方法。
【請求項６】
望ましくない植物を防除するための、請求項１若しくは２に記載の式（Ｉ）で表される化合物又は請求項３若しくは４に記載の除草剤組成物の使用。
【請求項７】
式（Ｉ）で表される化合物が有用な植物の作物の中の望ましくない植物を防除するために使用されることを特徴とする、請求項６に記載の使用。
【請求項８】
前記有用な植物が有用なトランスジェニック植物であることを特徴とする、請求項７に記載の使用。
【請求項９】
式（ＩＩ）
【化４】



(II)

〔式中、Ｘ、Ｒ、Ｚ及びｎは、請求項１又は２において定義されているとおりである〕で表される安息香酸。
【請求項１０】
式（ＩＩＩ）
【化５】



(III)

〔式中、Ｘ、Ｒ、Ｚ及びｎは、請求項１又は２において定義されているとおりである〕で表される塩化ベンゾイル。
【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】

本発明は、除草剤の技術分野、特に、有用な植物の作物の中の広葉雑草及びイネ科雑草を選択的に防除するための除草剤の技術分野に関する。

【背景技術】

【０００２】

ＷＯ　２０１２／０２８５７９Ａ１には、Ｎ－（テトラゾール－５－イル）アリールカルボキサミド類及びＮ－（トリアゾール－５－イル）アリールカルボキサミド類、並びに、除草剤としてのそれらの使用が開示されている。ＷＯ　２０１２／１２６９３２Ａ１には、Ｎ－（１，３，４－オキサジアゾール－２－イル）アリールカルボキサミド類及び除草剤としてのそれらの使用が記載されている。これらの中に記載されている活性成分は、有害な植物に対して必ずしも充分な活性を示さず、及び／又は、一部の活性成分は、穀類種、トウモロコシ及びイネなどの一部の重要な作物植物との充分な適合性を有していない。

【先行技術文献】

【特許文献】

【０００３】

【特許文献１】国際特許出願公開第２０１２／０２８５７９Ａ１号

【特許文献２】国際特許出願公開第２０１２／１２６９３２Ａ１号

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【０００４】

本発明の目的は、代替え的な除草活性成分を提供することである。

【課題を解決するための手段】

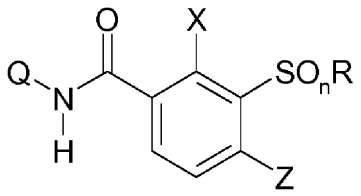
【０００５】

この目的は、２位にアルキル又はシクロアルキルラジカルを有し、３位に硫黄ラジカルを有し及び４位にシクロアルキルラジカルを有する、以下に記載されている本発明のアリールカルボキサミドによって達成される。

【０００６】

かくして、本発明は、式（Ｉ）

【化１】



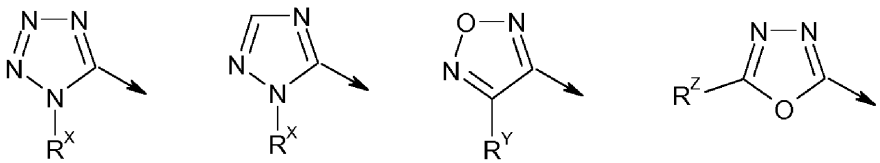
(I),

【０００７】

〔式中、記号及び添え字は、それぞれ、以下のように定義される：

Ｑは、Ｑ１、Ｑ２、Ｑ３又はＱ４ラジカル

【化２】



(Q1) (Q2) (Q3) (Q4)

【０００８】

であり；

Ｘは、（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$）－アルキル又は（Ｃ$_3$－Ｃ$_6$）－シクロアルキルであり；

Ｚは、（Ｃ$_3$－Ｃ$_6$）－シクロアルキルであり；

Ｒは、（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$）－アルキル、（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、（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$）－アルキル－Ｏ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_6$）－アルキルであり；
Ｒ^{X}は、メチル、エチル、ｎ－プロピル、プロパ－２－エン－１－イル、メトキシエチル、エトキシエチル又はメトキシエトキシエチルであり；
Ｒ^{Y}は、メチル、エチル、ｎ－プロピル、塩素又はアミノであり；
Ｒ^{Z}は、メチル、エチル、ｎ－プロピル又はメトキシメチルであり；
ｎは、０、１又は２である〕
で表されるアリールカルボキサミド又はその塩を提供する。

【０００９】

式（Ｉ）及び以下の全ての式において、３個以上の炭素原子を有しているアルキルラジカルは、直鎖又は分枝鎖であることができる。アルキルラジカルは、例えば、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソプロピル、ｎ－ブチル、イソブチル、ｔ－ブチル、２－ブチル、ペンチル類、ヘキシル類、例えば、ｎ－ヘキシル、イソヘキシル及び１，３－ジメチルブチルなどである。同様に、アルケニルは、例えば、アリル、１－メチルプロパ－２－エン－１－イル、２－メチルプロパ－２－エン－１－イル、ブタ－２－エン－１－イル、ブタ－３－エン－１－イル、１－メチルブタ－３－エン－１－イル及び１－メチルブタ－２－エン－１－イルなどである。アルキニルは、例えば、プロパルギル、ブタ－２－イン－１－イル、ブタ－３－イン－１－イル、１－メチルブタ－３－イン－１－イルなどである。多重結合は、各不飽和ラジカルの任意の位置に存在し得る。シクロアルキルは、３～６個の炭素原子を有している炭素環式飽和環系、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルなどである。同様に、シクロアルケニルは、３～６個の炭素環員を有している単環式アルケニル基、例えば、シクロプロペニル、シクロブテニル、シクロペンテニル及びシクロヘキセニルなどであり、ここで、二重結合は、任意の位置に存在し得る。

【００１０】

ある基が複数のラジカルで多置換されている場合、これは、該基が上記ラジカルから選択される１以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換されていることを意味する。

【００１１】

置換基の種類及びそれらの結合の仕方に応じて、一般式（Ｉ）で表される化合物は、立体異性体として存在し得る。例えば、不斉に置換されている１個以上の炭素原子が存在している場合、エナンチオマー及びジアステレオマーが存在し得る。ｎが１を表す場合（スルホキシド）にも立体異性体が存在し得る。立体異性体は、その調製において得られた混合物から、慣習的な分離方法によって、例えば、クロマトグラフ分離プロセスによって、得ることができる。さらにまた、光学的に活性な出発物質及び／又は補助剤を使用する立体選択的反応を用いることによって、立体異性体を選択的に調製することも可能である。本発明は、一般式（Ｉ）には包含されるが具体的には定義されていない全ての立体異性体及びその混合物にも関する。

【００１２】

式（Ｉ）で表される化合物は、塩を形成することができる。塩は、式（Ｉ）で表される化合物に塩基を作用させることによって、形成させることができる。適切な塩基の例は、以下のものである：有機アミン類、例えば、トリアルキルアミン類、モルホリン、ピペリジン及びピリジン、並びに、アンモニウム、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の水酸化物、炭酸塩及び炭酸水素塩、特に、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム及び炭酸水素カリウム。これらの塩は、当該酸性水素が農業上適切なカチオンで置き換えられている化合物、例えば、金属塩、特に、アルカリ金属塩若しくはアルカリ土類金属塩、特に、ナトリウム塩及びカリウム塩、又は、アンモニウム塩、有機アミンとの塩、又は、第４球アンモニウム塩、例えば、式［ＮＲ^{a}Ｒ^{b}Ｒ^{c}Ｒ^d］$^+$〔式中、Ｒ^a～Ｒ^{d}は、それぞれ独立して、有機ラジカル、特に、アルキル

、アリール、アラルキル又はアルキルアリールである〕で表されるカチオンとの塩である。同様に、アルキルスルホニウム塩及びアルキルスルホキソニウム塩、例えば、（C_1－C_4）－トリアルキルスルホニウム塩及び（C_1－C_4）－トリアルキルスルホキソニウム塩なども適している。

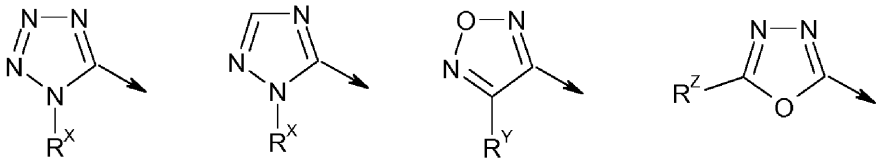
【発明を実施するための形態】

【００１３】

好ましいのは、一般式（Ｉ）〔式中、

Ｑは、Ｑ１、Ｑ２、Ｑ３又はＱ４ラジカル

【化３】



(Q1) (Q2) (Q3) (Q4)

【００１４】

であり；

Ｘは、メチル、エチル又はシクロプロピルであり；

Ｚは、シクロプロピル又はシクロブチルであり；

Ｒは、メチル、エチル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル又はメトキシエチルであり；

R^Xは、メチル、エチル、ｎ－プロピル、プロパ－２－エン－１－イル、メトキシエチル、エトキシエチル又はメトキシエトキシエチルであり；

R^Yは、メチル、エチル、ｎ－プロピル、塩素又はアミノであり；

R^Zは、メチル、エチル、ｎ－プロピル又はメトキシメチルであり；

ｎは、０、１又は２である〕

で表される化合物である。

【００１５】

以下で特定されている全ての式において、その置換基及び記号は、異なって定義されていないかぎり、式（Ｉ）において記載されている意味と同じ意味を有する。

【００１６】

ＱがＱ１又はＱ２である本発明の化合物、並びに、これらアミドの基礎をなしているアミノテトラゾール及びアミノトリアゾールは、例えば、ＷＯ　２０１２／０２８５７９に記載されている方法によって、調製することができる。

【００１７】

ＱがＱ３である本発明の化合物、及び、これらアミドの基礎をなしているアミノフラザンは、例えば、ＷＯ　２０１１／０３５８７４に記載されている方法によって、調製することができる。

【００１８】

ＱがＱ４である本発明の化合物は、例えば、ＷＯ　２０１２／１２６９３２に記載されている方法によって、調製することができる。これらアミドの基礎をなしている２－アミノ－１，３，４－オキサジアゾールは、市販されているか、又は、文献中に充分に記載されている標準的な方法によって合成的に得ることができる。

【００１９】

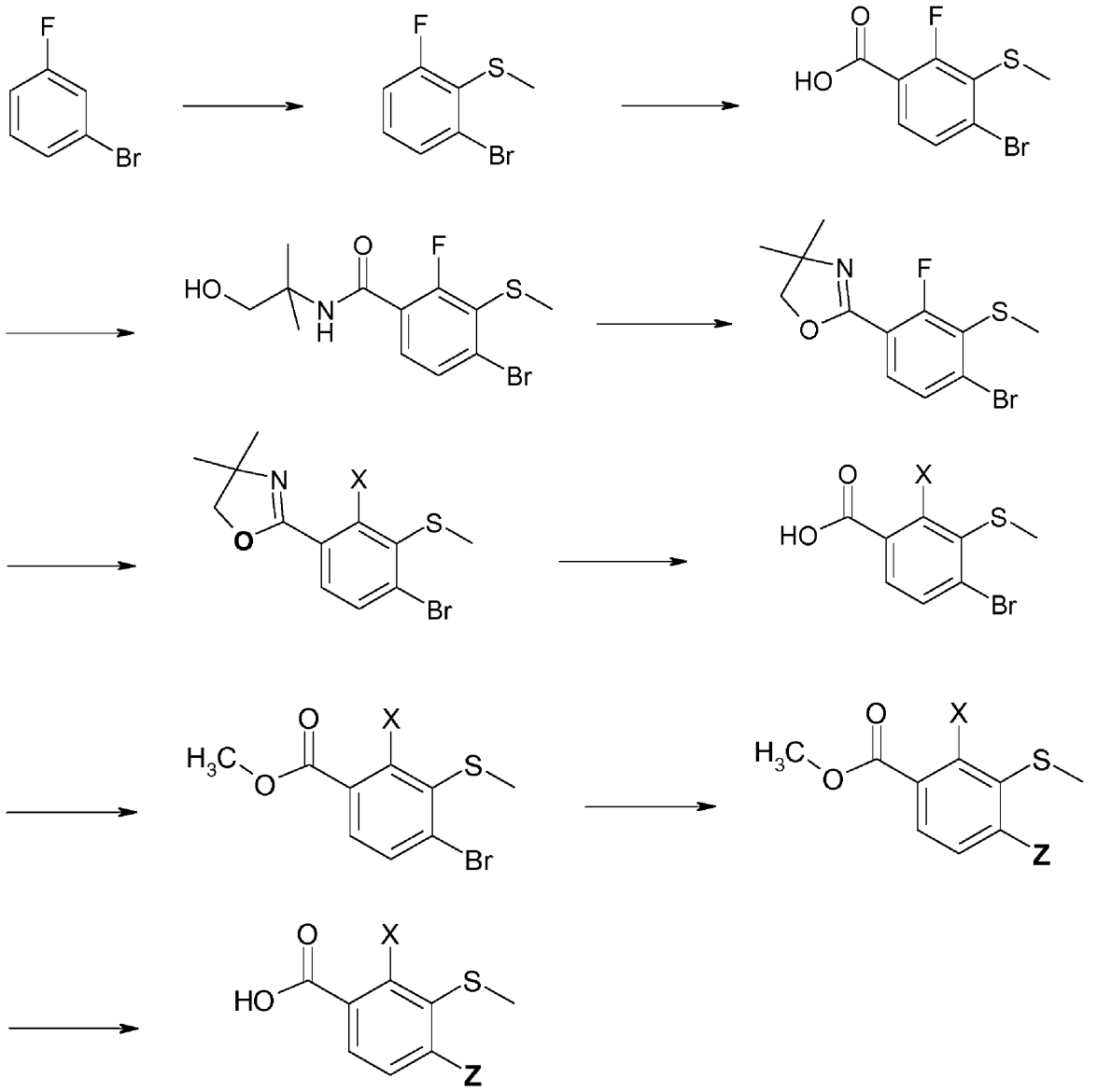
本発明の化合物の基礎をなしている塩化ベンゾイル又は対応する安息香酸は、例えば、スキーム１（これは、一例として、「Ｒラジカル＝メチル」である場合に関する）において示されている方法によって、調製することができる。この目的のために、１－ブロモ－３－フルオロベンゼンを、その２位においてリチウム化に付す。次いで、そのカルボアニオンをチオエーテルに変換させる。その後、フッ素原子を介するオルト位を対象としたリ

チウム化と、それに続くカルボキシル化によって、当該安息香酸を合成する（Ｍａｔｔｈｅｗ Ｄ. Ｍｏｒｒｉｓｏｎ ｅｔ ａｌ., Ｏｒｇａｎｉｃ Ｌｅｔｔｅｒｓ, ２００９, ｖｏｌ. １１, # ５ ｐ.１０５１－１０５４; Ｑｉｕｐｉｎｇ Ｗａｎｇ ｅｔ ａｌ., Ｊｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｍｅｄｉｃｉｎａｌ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ, ２００７, ｖｏｌ. ５０, # ２ ｐ.１９９－２１０）。オキサゾリン基を形成させた後、該フッ素原子を求核的にアルキル又はシクロアルキルラジカルと交換させることができる（Ａ. Ｉ. Ｍｅｙｅｒｓ ｅｔ ａｌ., Ｔｅｔｒａｈｅｄｒｏｎ Ｌｅｔｔｅｒｓ, １９７８, ３, ２２３－２２６; Ａ. Ｉ. Ｍｅｙｅｒｓ ｅｔ ａｌ., Ｔｅｔｒａｈｅｄｒｏｎ, １９９４, ５０（８）, ２２９７－２３６０; Ｔ. Ｗ. Ｇｒｅｅｎｅ, Ｐ. Ｇ. Ｍ. Ｗｕｔｓ, Ｐｒｏｔｅｃｔｉｖｅ Ｇｒｏｕｐｓ ｉｎ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ, ２ｎｄ Ｅｄｉｔｉｏｎ, Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ & Ｓｏｎｓ, Ｉｎｃ. １９９１, Ｓ. ２６５ ｆｆ.; Ｚ. Ｈｅｌｌ ｅｔ ａｌ., Ｔｅｔｒａｈｅｄｒｏｎ Ｌｅｔｔｅｒｓ, ２００２, ４３, ３９８５－３９８７）。その後、オキサゾリンを開裂させることによって、置換されている４－ブロモ－３－メチルチオ安息香酸が得られる。これを、メチルエステルの形態でクロスカップリングに付す。４位に置換基を導入し、次いで、エステルを加水分解して、当該安息香酸の合成が完了する。

【００２０】

スキーム１

【化４】



【００２１】

該チオエーテルをさらに酸化して、対応するスルホキシド又はスルホンとすることができる（スキーム２）。選択的にスルホキシド又はスルホンをもたらす酸化方法は、文献から知られている。多くの種類の可能な酸化系（例えば、過酸、例えば、メタ－クロロ過安息香酸）が存在しており、ここで、これは、場合によりその場で生成させてもよい（例えば、「酢酸／過酸化水素／タングステン酸（ＶＩ）ナトリウム」系における過酢酸）（Ｈｏｕｂｅｎ－Ｗｅｙｌ，Ｍｅｔｈｏｄｅｎ ｄｅｒ Ｏｒｇａｎｉｓｃｈｅｎ Ｃｈｅｍｉｅ［Ｍｅｔｈｏｄｓ ｏｆ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ］，Ｇｅｏｒｇ Ｔｈｉｅｍｅ Ｖｅｒｌａｇ Ｓｔｕｔｔｇａｒｔ，Ｖｏｌ．Ｅ １１，ｅｘｐａｎｄｅｄ ａｎｄ ｓｕｐｐｌｅｍｅｎｔａｒｙ ｖｏｌｕｍｅｓ ｔｏ ｔｈｅ ４ｔｈ ｅｄｉｔｉｏｎ １９８５，ｐ．７０２ ｆｆ．，ｐ．７１８ ｆｆ．ａｎｄ ｐ．１１９４ ｆｆ．）。

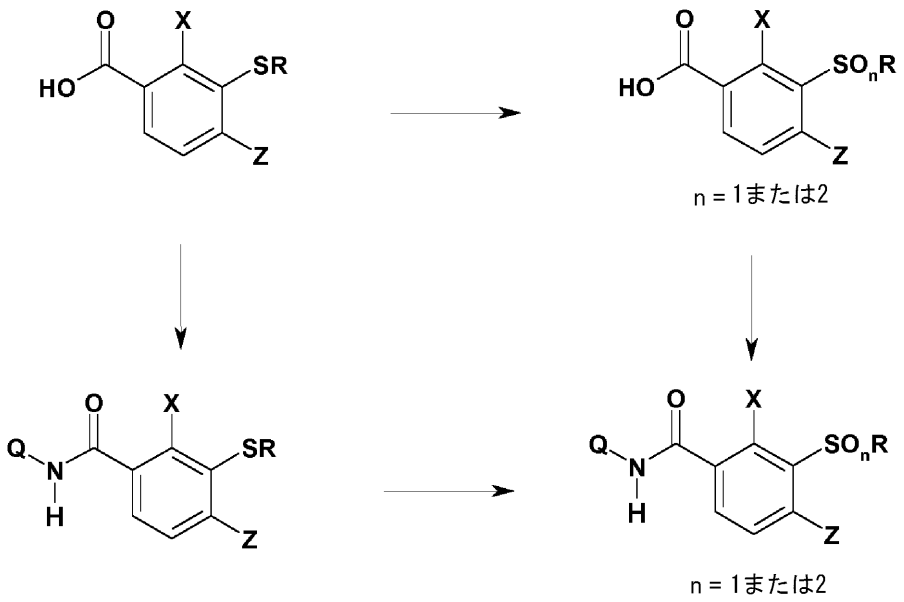
【００２２】

当該置換パターン及び当該酸化剤は、合成カスケードの中で該チオエーテルを酸化するのが適切である時点を決定する因子である。酸化は、例えば、遊離安息香酸の段階又は式（Ｉ）〔式中、ｎ＝０〕で表されるアミドの段階で実施するのが適切であり得る（スキーム２）。

【００２３】

スキーム２

【化５】



【００２４】

該反応段階の順序を変更するのは適切であり得る。例えば、スルホキシドを有している安息香酸は、それらの酸塩化物に直接変換させることはできない。ここで、１つの選択肢は、チオエーテル段階において、最初に、式（Ｉ）〔式中、ｎ＝０〕で表されるアミドを調製し、次いで、そのチオエーテルを酸化してスルホキシドとすることである。

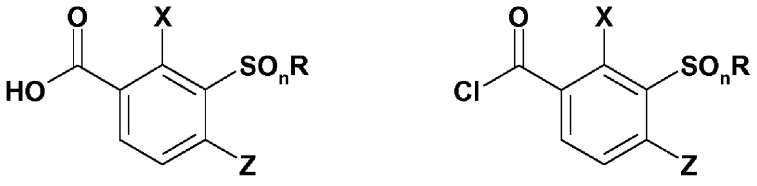
【００２５】

それぞれの反応混合物の後処理は、一般に、既知方法によって、例えば、結晶化、水性抽出後処理によって、クロマトグラフ法によって、又は、それらの方法を組み合わせたものによって、実施する。

【００２６】

式（Ｉ）で表される本発明化合物の調製において中間体として使用される式（ＩＩ）で表される安息香酸及び式（ＩＩＩ）で表される塩化ベンゾイルは、新規であり、そして、同様に、本発明の対象の一部を形成する。

【化６】



(II) (III)

【００２７】

上記反応によって合成することが可能な式（Ｉ）で表される化合物及び／又はそれらの塩のコレクションは、並行的に調製することも可能であり、その場合、これは、手動で、部分的に自動化で、又は、完全に自動化で、実施することが可能である。例えば、生成物及び／若しくは中間体の反応、後処理又は精製の実施を自動化することが可能である。概して、これは、例えば、「Ｃｏｍｂｉｎａｔｏｒｉａｌ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ － Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ, Ａｎａｌｙｓｉｓ, Ｓｃｒｅｅｎｉｎｇ（ｅｄｉｔｏｒ：Ｇｕｎｔｈｅｒ Ｊｕｎｇ）, Ｗｉｌｅｙ, １９９９」の第１～３４頁においてＤ．Ｔｉｅｂｅｓによって記載された方法を意味するものと理解される。反応及び後処理の並行的な実施に関しては、多くの市販されている機器、例えば、「Ｂａｒｎｓｔｅａｄ Ｉｎｔｅｒｎａｔｉｏｎａｌ, Ｄｕｂｕｑｕｅ, Ｉｏｗａ ５２００４－０７９７, ＵＳ

A」製の「Ｃａｌｙｐｓｏ ｒｅａｃｔｉｏｎ ｂｌｏｃｋｓ」又は「Ｒａｄｌｅｙｓ，Ｓｈｉｒｅｈｉｌｌ，Ｓａｆｆｒｏｎ Ｗａｌｄｅｎ，Ｅｓｓｅｘ，ＣＢ１１３ＡＺ，Ｅｎｇｌａｎｄ」製の反応ステーション又は「ＰｅｒｋｉｎＥｌｍｅｒ，Ｗａｌｔｈａｍ，Ｍａｓｓａｃｈｕｓｅｔｔｓ ０２４５１，ＵＳＡ」製の「ＭｕｌｔｉＰＲＯＢＥ Ａｕｔｏｍａｔｅｄ Ｗｏｒｋｓｔａｔｉｏｎｓ」などを使用することが可能である。一般式（Ｉ）で表される化合物及びそれらの塩の並行精製又は調製の過程で生じる中間体の並行精製に関しては、利用可能な装置としては、クロマトグラフィー装置、例えば、「ＩＳＣＯ，Ｉｎｃ．，４７００ Ｓｕｐｅｒｉｏｒ Ｓｔｒｅｅｔ，Ｌｉｎｃｏｌｎ，ＮＥ ６８５０４，ＵＳＡ」製のクロマトグラフィー装置などがある。

【００２８】

上記装置は、個々の作業段階が自動化されているモジュール式方法をもたらすが、作業段階の間では手動による操作を行わなければならない。これは、個々の自動化モジュールが例えばロボットによって操作される部分的に又は完全に一体化された自動化システムを用いて回避することができる。このタイプの自動化システムは、例えば、「Ｃａｌｉｐｅｒ，Ｈｏｐｋｉｎｔｏｎ，ＭＡ ０１７４８，ＵＳＡ」から入手することができる。

【００２９】

単一又は複数の合成段階の実施は、ポリマー担持試薬／スカベンジャー樹脂を使用することにより補助することができる。専門的な文献（例えば、「ＣｈｅｍＦｉｌｅｓ，Ｖｏｌ．４，Ｎｏ．１，Ｐｏｌｙｍｅｒ－Ｓｕｐｐｏｒｔｅｄ Ｓｃａｖｅｎｇｅｒｓ ａｎｄ Ｒｅａｇｅｎｔｓ ｆｏｒ Ｓｏｌｕｔｉｏｎ－Ｐｈａｓｅ Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ（Ｓｉｇｍａ－Ａｌｄｒｉｃｈ）」）には、一連の実験プロトコルが記載されている。

【００３０】

ここに記載されている方法に加えて、一般式（Ｉ）で表される化合物及びそれらの塩は、固相担持方法（ｓｏｌｉｄ－ｐｈａｓｅ ｓｕｐｐｏｒｔｅｄ ｍｅｔｈｏｄ）によって部分的に又は完全に調製することが可能である。この目的のために、当該合成における個々の中間体若しくは全ての中間体、又は、対応する手順に適合させた合成における個々の中間体若しくは全ての中間体を、合成用樹脂に結合させる。固相担持合成方法は、技術文献、例えば、「Ｂａｒｒｙ Ａ．Ｂｕｎｉｎ ｉｎ “Ｔｈｅ Ｃｏｍｂｉｎａｔｏｒｉａｌ Ｉｎｄｅｘ”，Ａｃａｄｅｍｉｃ Ｐｒｅｓｓ，１９９８」及び「Ｃｏｍｂｉｎａｔｏｒｉａｌ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ － Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ，Ａｎａｌｙｓｉｓ，Ｓｃｒｅｅｎｉｎｇ（ｅｄｉｔｏｒ：Ｇｕｎｔｈｅｒ Ｊｕｎｇ），Ｗｉｌｅｙ，１９９９」に充分に記載されている。固相担持合成方法を使用することで、手動で又は自動化された方法で実施することが可能な文献から知られている多くのプロトコルが可能となる。該反応は、例えば、「Ｎｅｘｕｓ Ｂｉｏｓｙｓｔｅｍｓ，１２１４０ Ｃｏｍｍｕｎｉｔｙ Ｒｏａｄ，Ｐｏｗａｙ，ＣＡ９２０６４，ＵＳＡ」製のマイクロ反応器の中でＩＲＯＲＩ技術を用いることによって、実施することができる。

【００３１】

固相上においても、及び、液相中においても、単一の合成段階又は複数の合成段階の実施（ｃｏｎｄｕｃｔｉｏｎ）は、マイクロ波技術を使用することにより補助することができる。専門的な文献（例えば、「Ｍｉｃｒｏｗａｖｅｓ ｉｎ Ｏｒｇａｎｉｃ ａｎｄ Ｍｅｄｉｃｉｎａｌ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ（ｅｄｉｔｏｒ：Ｃ．Ｏ．Ｋａｐｐｅ ａｎｄ Ａ．Ｓｔａｄｌｅｒ），Ｖｅｒｌａｇ Ｗｉｌｅｙ，２００５」）には、一連の実験プロトコルが記載されている。

【００３２】

ここに記載されている調製方法で調製することによって、式（Ｉ）で表される化合物及びそれらの塩が、ライブラリーと称される物質コレクションの形態で得られる。本発明は、式（Ｉ）で表される少なくとも２種類の化合物及びそれらの塩を含んでいるライブラリ

ーも提供する。

【００３３】

本発明の化合物は、広範囲の経済的に重要な単子葉及び双子葉の一年生有害植物に対して優れた除草効力を示す。該活性成分は、根茎、根株及び別の多年生器官から苗条を生じる、防除が困難な多年生雑草に対しても効果的に作用する。

【００３４】

本発明は、従って、望ましくない植物を防除する方法又は植物の成長を調節する方法、好ましくは作物植物内において、望ましくない植物を防除する方法又は植物の成長を調節する方法も提供し、ここで、該方法においては、本発明による１種類以上の化合物を、該植物（例えば、有害植物、例えば、単子葉雑草若しくは双子葉雑草、又は、望ましくない作物植物）に施用するか、又は、種子（例えば、穀粒、種子、又は、栄養繁殖器官、例えば、塊茎、若しくは、芽を有する苗条部分）に施用するか、又は、当該植物がそこで成長している区域（例えば、耕作地）に施用する。本発明の化合物は、例えば、植え付け前（適切な場合には、土壌に混和することによって）、発生前又は発生後に使用することができる。本発明の化合物によって防除することが可能な何種類かの代表的な単子葉雑草植物相及び双子葉雑草植物相の具体的な例は以下のとおりであるが、そのような記載は特定の種に限定することを意図するものではない。

【００３５】

以下の属の単子葉有害植物：　アエギロプス属（Ａｅｇｉｌｏｐｓ）、カモジグサ属（Ａｇｒｏｐｙｒｏｎ）、ヌカボ属（Ａｇｒｏｓｔｉｓ）、スズメノテッポウ属（Ａｌｏｐｅｃｕｒｕｓ）、セイヨウヌカボ属（Ａｐｅｒａ）、カラスムギ属（Ａｖｅｎａ）、ビロードキビ属（Ｂｒａｃｈｉａｒｉａ）、スズメノチャヒキ属（Ｂｒｏｍｕｓ）、クリノイガ属（Ｃｅｎｃｈｒｕｓ）、ツユクサ属（Ｃｏｍｍｅｌｉｎａ）、ギョウギシバ属（Ｃｙｎｏｄｏｎ）、カヤツリグサ属（Ｃｙｐｅｒｕｓ）、タツノツメガヤ属（Ｄａｃｔｙｌｏｃｔｅｎｉｕｍ）、メヒシバ属（Ｄｉｇｉｔａｒｉａ）、ヒエ属（Ｅｃｈｉｎｏｃｈｌｏａ）、ハリイ属（Ｅｌｅｏｃｈａｒｉｓ）、オヒシバ属（Ｅｌｅｕｓｉｎｅ）、スズメガヤ属（Ｅｒａｇｒｏｓｔｉｓ）、ナルコビエ属（Ｅｒｉｏｃｈｌｏａ）、ウシノケグサ属（Ｆｅｓｔｕｃａ）、テンツキ属（Ｆｉｍｂｒｉｓｔｙｌｉｓ）、アメリカコナギ属（Ｈｅｔｅｒａｎｔｈｅｒａ）、チガヤ属（Ｉｍｐｅｒａｔａ）、カモノハシ属（Ｉｓｃｈａｅｍｕｍ）、アゼガヤ属（Ｌｅｐｔｏｃｈｌｏａ）、ドクムギ属（Ｌｏｌｉｕｍ）、ミズアオイ属（Ｍｏｎｏｃｈｏｒｉａ）、キビ属（Ｐａｎｉｃｕｍ）、スズメノヒエ属（Ｐａｓｐａｌｕｍ）、クサヨシ属（Ｐｈａｌａｒｉｓ）、アワガエリ属（Ｐｈｌｅｕｍ）、イチゴツナギ属（Ｐｏａ）、ツノアイアシ属（Ｒｏｔｔｂｏｅｌｌｉａ）、オモダカ属（Ｓａｇｉｔｔａｒｉａ）、ホタルイ属（Ｓｃｉｒｐｕｓ）、エノコログサ属（Ｓｅｔａｒｉａ）、及び、モロコシ属（Ｓｏｒｇｈｕｍ）。

【００３６】

以下の属の双子葉雑草：　イチビ属（Ａｂｕｔｉｌｏｎ）、ヒユ属（Ａｍａｒａｎｔｈｕｓ）、ブタクサ属（Ａｍｂｒｏｓｉａ）、アノダ属（Ａｎｏｄａ）、カミツレ属（Ａｎｔｈｅｍｉｓ）、アファネス属（Ａｐｈａｎｅｓ）、ヨモギ属（Ａｒｔｅｍｉｓｉａ）、ハマアカザ属（Ａｔｒｉｐｌｅｘ）、ヒナギク属（Ｂｅｌｌｉｓ）、センダングサ属（Ｂｉｄｅｎｓ）、ナズナ属（Ｃａｐｓｅｌｌａ）、ヒレアザミ属（Ｃａｒｄｕｕｓ）、カワラケツメイ属（Ｃａｓｓｉａ）、ヤグルマギク属（Ｃｅｎｔａｕｒｅａ）、アカザ属（Ｃｈｅｎｏｐｏｄｉｕｍ）、アザミ属（Ｃｉｒｓｉｕｍ）、セイヨウヒルガオ属（Ｃｏｎｖｏｌｖｕｌｕｓ）、チョウセンアサガオ属（Ｄａｔｕｒａ）、ヌスビトハギ属（Ｄｅｓｍｏｄｉｕｍ）、エメキス属（Ｅｍｅｘ）、エゾスズシロ属（Ｅｒｙｓｉｍｕｍ）、トウダイグサ属（Ｅｕｐｈｏｒｂｉａ）、チシマオドリコソウ属（Ｇａｌｅｏｐｓｉｓ）、コゴメギク属（Ｇａｌｉｎｓｏｇａ）、ヤエムグラ属（Ｇａｌｉｕｍ）、フヨウ属（Ｈｉｂｉｓｃｕｓ）、サツマイモ属（Ｉｐｏｍｏｅａ）、ホウキギ属（Ｋｏｃｈｉａ）、オドリコソウ属（Ｌａｍｉｕｍ）、マメグンバイナズナ属（Ｌｅｐｉｄｉｕｍ）、アゼトウガラシ属（Ｌｉｎｄｅｒｎｉａ）、シカギク属（Ｍａｔｒｉｃａｒｉａ）、ハッカ属（Ｍｅｎｔ

ｈａ）、ヤマアイ属（Ｍｅｒｃｕｒｉａｌｉｓ）、ザクロソウ属（Ｍｕｌｌｕｇｏ）、ワスレナグサ属（Ｍｙｏｓｏｔｉｓ）、ケシ属（Ｐａｐａｖｅｒ）、アサガオ属（Ｐｈａｒｂｉｔｉｓ）、オオバコ属（Ｐｌａｎｔａｇｏ）、タデ属（Ｐｏｌｙｇｏｎｕｍ）、スベリヒユ属（Ｐｏｒｔｕｌａｃａ）、キンポウゲ属（Ｒａｎｕｎｃｕｌｕｓ）、ダイコン属（Ｒａｐｈａｎｕｓ）、イヌガラシ属（Ｒｏｒｉｐｐａ）、キカシグサ属（Ｒｏｔａｌａ）、ギシギシ属（Ｒｕｍｅｘ）、オカヒジキ属（Ｓａｌｓｏｌａ）、キオン属（Ｓｅｎｅｃｉｏ）、セスバニア属（Ｓｅｓｂａｎｉａ）、キンゴジカ属（Ｓｉｄａ）、シロガラシ属（Ｓｉｎａｐｉｓ）、ナス属（Ｓｏｌａｎｕｍ）、ノゲシ属（Ｓｏｎｃｈｕｓ）、ナガボノウルシ属（Ｓｐｈｅｎｏｃｌｅａ）、ハコベ属（Ｓｔｅｌｌａｒｉａ）、タンポポ属（Ｔａｒａｘａｃｕｍ）、グンバイナズナ属（Ｔｈｌａｓｐｉ）、シャジクソウ属（Ｔｒｉｆｏｌｉｕｍ）、イラクサ属（Ｕｒｔｉｃａ）、クワガタソウ属（Ｖｅｒｏｎｉｃａ）、スミレ属（Ｖｉｏｌａ）、及び、オナモミ属（Ｘａｎｔｈｉｕｍ）。

【００３７】

本発明の化合物が発芽前に土壌表面に施用される場合、雑草の実生の出芽が完全に防止されるか、又は、雑草は、子葉期に達するまで成長するが、その後成長を停止し、そして最終的には、３～４週間経過した後、完全に枯死する。

【００３８】

該活性成分が植物の緑色の部分に発生後施用される場合は、その処理の後で成長は停止し、そして、当該有害植物は、施用時点における成長段階にとどまるか、又は、一定期間の後、完全に枯死し、その結果、作物植物にとって有害である雑草との競合が、極めて早期に持続的に排除される。

【００３９】

本発明の化合物は単子葉雑草及び双子葉雑草に対して優れた除草活性を示すが、経済的に重要な作物の作物植物、例えば、ラッカセイ属（Ａｒａｃｈｉｓ）、フダンソウ属（Ｂｅｔａ）、アブラナ属（Ｂｒａｓｓｉｃａ）、キュウリ属（Ｃｕｃｕｍｉｓ）、カボチャ属（Ｃｕｃｕｒｂｉｔａ）、ヒマワリ属（Ｈｅｌｉａｎｔｈｕｓ）、ニンジン属（Ｄａｕｃｕｓ）、ダイズ属（Ｇｌｙｃｉｎｅ）、ワタ属（Ｇｏｓｓｙｐｉｕｍ）、サツマイモ属（Ｉｐｏｍｏｅａ）、アキノノゲシ属（Ｌａｃｔｕｃａ）、アマ属（Ｌｉｎｕｍ）、トマト属（Ｌｙｃｏｐｅｒｓｉｃｏｎ）、ススキ属（Ｍｉｓｃａｎｔｈｕｓ）、タバコ属（Ｎｉｃｏｔｉａｎａ）、インゲンマメ属（Ｐｈａｓｅｏｌｕｓ）、エンドウ属（Ｐｉｓｕｍ）、ナス属（Ｓｏｌａｎｕｍ）、ソラマメ属（Ｖｉｃｉａ）の双子葉作物の作物植物、又は、ネギ属（Ａｌｌｉｕｍ）、アナナス属（Ａｎａｎａｓ）、クサスギカズラ属（Ａｓｐａｒａｇｕｓ）、カラスムギ属（Ａｖｅｎａ）、オオムギ属（Ｈｏｒｄｅｕｍ）、イネ属（Ｏｒｙｚａ）、キビ属（Ｐａｎｉｃｕｍ）、サトウキビ属（Ｓａｃｃｈａｒｕｍ）、ライムギ属（Ｓｅｃａｌｅ）、モロコシ属（Ｓｏｒｇｈｕｍ）、ライコムギ属（Ｔｒｉｔｉｃａｌｅ）、コムギ属（Ｔｒｉｔｉｃｕｍ）、トウモロコシ属（Ｚｅａ）〔特に、トウモロコシ属（Ｚｅａ）、及び、コムギ属（Ｔｒｉｔｉｃｕｍ）〕の単子葉植物の作物植物は、本発明の個々の化合物の構造及びその施用量に応じて、仮に損傷を受けるとしても、ほんの僅かにしか損傷をうけない。このようなわけで、本発明化合物は、農業上有用な植物などの作物植物又は観賞植物における望ましくない植物の成長を選択的に制御するのに非常に適している。

【００４０】

さらに、本発明の化合物は、それらの個々の化学構造及び使用される施用量に応じて、作物植物において優れた成長調節特性を有する。それらは、調節的な効果を伴って植物自体の代謝に介入し、従って、植物の成分に対して制御された影響を及ぼすために本発明の化合物を使用して、例えば乾燥及び成長阻害を誘発することによって、収穫を促進することができる。さらに、それらは、植物を枯死させることなく植物の望ましくない成長を全体的に制御及び阻害するのにも適している。植物の成長を阻害することは、例えばそれによって倒伏が低減され得るか又は完全に防止され得るので、多くの種類の単子葉作物及び双子葉作物に対して重要な役割を果たしている。

【００４１】
本発明の活性化合物は、その除草特性及び植物成長調節特性によって、既知遺伝子組換え植物又は今後開発される遺伝子組換え植物の作物の中の有害な植物を防除するために用いることもできる。一般に、トランスジェニック植物は、特定の有利な特性によって、例えば、特定の殺有害生物剤（特に、特定の除草剤）に対する抵抗性、植物病害又は植物病害の病原体（例えば、特定の昆虫類又は微生物、例えば、菌類、細菌類若しくはウイルス類）に対する抵抗性などよって、特徴付けられる。別の特定の特性は、例えば、収穫物の、量、質、貯蔵性、組成及び特定の成分などに関する。例えば、デンプン含有量が増大されているか若しくはデンプンの質が変性されている既知トランスジェニック植物、又は、収穫物内の脂肪酸組成が異なっている既知トランスジェニック植物が存在している。特定のさらなる特性は、非生物的ストレス因子、例えば、熱、低温、渇水、塩分及び紫外線などに対する耐性又は抵抗性であり得る。

【００４２】
好ましくは、有用な植物及び観賞植物〔例えば、穀類、例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、カラスムギ、アワ、イネ、キャッサバ及びトウモロコシ、又は、テンサイ、ワタ、ダイズ、ナタネ、ジャガイモ、トマト、エンドウ及び他の野菜類の作物〕の経済的に重要なトランスジェニック作物において、本発明の式（Ｉ）で表される化合物又はその塩を使用する。

【００４３】
式（Ｉ）で表される化合物は、好ましくは、除草剤として、当該除草剤の植物毒性効果に対して抵抗性であるか又は組換え手段によって抵抗性にされた有用な植物の作物において、使用することができる。

【００４４】
既存の植物と比較して改質された特性を有する新規植物を生成させる慣習的な方法は、例えば、従来の栽培法及び突然変異体の生成である。別法として、変更された特性を有する新規植物は、組換え法を用いて生成させることができる（例えば、ＥＰ　０２２１０４４、ＥＰ　０１３１６２４を参照されたい）。例えば、以下のことは、いくつかの場合において記載されている：

・　植物体内で合成されるデンプンを改質することを目的とする作物植物の遺伝子組換え（例えば、ＷＯ　９２／０１１３７６Ａ、ＷＯ　９２／０１４８２７Ａ、ＷＯ　９１／０１９８０６Ａ）；

・　グルホシネートタイプ（ｃｆ．　例えば、ＥＰ　０２４２２３６Ａ、ＥＰ　０２４２２４６Ａ）若しくはグリホセートタイプ（ＷＯ　９２／０００３７７Ａ）若しくはスルホニル尿素タイプ（ＥＰ　０２５７９９３Ａ、ＵＳ　５，０１３，６５９）の特定の除草剤に対して抵抗性を示す、又は、「遺伝子スタッキング（ｇｅｎｅ　ｓｔａｃｋｉｎｇ）」によってそれら除草剤の組合せ若しくは混合物に対して抵抗性を示す、トランスジェニック作物植物、例えば、Ｏｐｔｉｍｕｍ™　ＧＡＴ™（グリホセートＡＬＳ耐性）の商品名又は名称を有するトランスジェニック作物植物、例えば、トウモロコシ又はダイズ；

・　植物を特定の害虫に対して抵抗性を示すようにするバシルス・ツリンギエンシス毒素（Ｂｔ毒素）を産生することができるトランスジェニック作物植物（例えば、ワタ）（ＥＰ－Ａ－０１４２９２４、ＥＰ－Ａ－０１９３２５９）；

・　改変された脂肪酸組成を有するトランスジェニック作物植物（ＷＯ　９１／０１３９７２Ａ）；

・　新規成分又は二次代謝産物（例えば、耐病性を向上させる新規フィトアレキシンなど）を有する遺伝子組換えされた作物植物（ＥＰ　３０９８６２Ａ、ＥＰ　０４６４４６１Ａ）；

・　より多い収穫量及びより高いストレス耐性を有する、光呼吸が低下した遺伝子組換え植物（ＥＰ　０３０５３９８Ａ）；

・　薬学的に又は診断的に重要なタンパク質を産生するトランスジェニック作物植物（

「分子ファーミング（ｍｏｌｅｃｕｌａｒ　ｐｈａｒｍｉｎｇ）」）；
・　より多い収穫量又はより優れた品質を特徴とするトランスジェニック作物植物；
・　例えば上記で記載した新規特性の組み合わせによって区別される、トランスジェニック作物（「遺伝子スタッキング」）。

【００４５】
改質された特性を有する新規トランスジェニック植物を産生させために使用することが可能な多くの分子生物学的技術が、原則として知られている；例えば，以下のものを参照されたい：「Ｉ．Ｐｏｔｒｙｋｕｓ　ａｎｄ　Ｇ．Ｓｐａｎｇｅｎｂｅｒｇ（ｅｄｓ．），Ｇｅｎｅ　Ｔｒａｎｓｆｅｒ　ｔｏ　Ｐｌａｎｔｓ，Ｓｐｒｉｎｇｅｒ　Ｌａｂ　Ｍａｎｕａｌ（１９９５），Ｓｐｒｉｎｇｅｒ　Ｖｅｒｌａｇ　Ｂｅｒｌｉｎ，Ｈｅｉｄｅｌｂｅｒｇ」、又は、「Ｃｈｒｉｓｔｏｕ，“Ｔｒｅｎｄｓ　ｉｎ　Ｐｌａｎｔ　Ｓｃｉｅｎｃｅ”１（１９９６）４２３－４３１」。

【００４６】
そのような組換え操作に関して、突然変異誘発又はＤＮＡ配列の組換えによる配列変更を可能にする核酸分子をプラスミドの中に導入することができる。標準的な方法を用いて、例えば、塩基交換を実施することが可能であり、配列の一部分を除去することが可能であり、又は、天然配列若しくは合成配列を加えることが可能である。ＤＮＡ断片を互いに連結させるために、その断片にアダプター又はリンカーを加えることができる；例えば、以下のものを参照されたい：「Ｓａｍｂｒｏｏｋ　ｅｔ　ａｌ．，１９８９，Ｍｏｌｅｃｕｌａｒ　Ｃｌｏｎｉｎｇ，Ａ　Ｌａｂｏｒａｔｏｒｙ　Ｍａｎｕａｌ，２ｎｄ　ｅｄ．，Ｃｏｌｄ　Ｓｐｒｉｎｇ　Ｈａｒｂｏｒ　Ｌａｂｏｒａｔｏｒｙ　Ｐｒｅｓｓ，Ｃｏｌｄ　Ｓｐｒｉｎｇ　Ｈａｒｂｏｒ，ＮＹ」、又は、「Ｗｉｎｎａｃｋｅｒ“Ｇｅｎｅ　ｕｎｄ　Ｋｌｏｎｅ”，ＶＣＨ　Ｗｅｉｎｈｅｉｍ　２ｎｄ　ｅｄｉｔｉｏｎ，１９９６」。

【００４７】
例えば、遺伝子産物の活性が低下した植物細胞の生成は、少なくとも１の対応するアンチセンスＲＮＡを発現させることによって、又は、コサプレッション効果を達成するためのセンスＲＮＡを発現させることによって、又は、前記遺伝子産物の転写産物を特異的に切断する少なくとも１の適切に構築されたリボザイムを発現させることによって、達成することができる。

【００４８】
この目的のために、最初に、存在し得る全てのフランキング配列を含む遺伝子産物の全コード配列を含んでいるＤＮＡ分子を使用することが可能であり、さらにまた、コード配列の一部分だけを含んでいるＤＮＡ分子（この場合、これらの部分は、細胞内においてアンチセンス効果を有するのに充分なほど長いことが必要である）を使用することも可能である。さらにまた、遺伝子産物のコード配列と高度に相同性を有するが、それらと完全に同一なわけではないＤＮＡ配列を用いることもできる。

【００４９】
植物体内で核酸分子を発現させる場合、合成されたタンパク質は、植物細胞の任意の望ましい区画内に局在化させ得る。しかしながら、特定の区画内に局在化させるためには、例えば、特定の区画内に局在化することを保証するＤＮＡ配列にコード領域を連結させることが可能である。そのような配列は、当業者には知られている（例えば、以下のものを参照されたい：「Ｂｒａｕｎ　ｅｔ　ａｌ．，ＥＭＢＯ　Ｊ．１１（１９９２），３２１９－３２２７」、「Ｗｏｌｔｅｒ　ｅｔ　ａｌ．，Ｐｒｏｃ．Ｎａｔｌ．Ａｃａｄ．Ｓｃｉ．ＵＳＡ　８５（１９８８），８４６－８５０」、「Ｓｏｎｎｅｗａｌｄ　ｅｔ　ａｌ．，Ｐｌａｎｔ　Ｊ．１（１９９１），９５－１０６」）。さらにまた、そのような核酸分子は、植物細胞の細胞小器官内で発現させることも可能である。

【００５０】
トランスジェニック植物細胞は、完全な植物を生じさせるための既知技術によって再生

させることができる。原則として、トランスジェニック植物は、任意の望ましい植物種の植物であり得る、即ち、単子葉植物であり得るのみではなく、双子葉植物でもあり得る。

【００５１】

かくして、相同性の（＝天然の）遺伝子若しくは遺伝子配列の過剰発現、抑制若しくは阻害又は非相同性の（＝外来の）遺伝子若しくは遺伝子配列の発現によってその特性が変更されているトランスジェニック植物を得ることができる。

【００５２】

本発明の化合物（Ｉ）は、好ましくは、成長調節剤（例えば、２，４－Ｄ、ジカンバ）に対して抵抗性を示すトランスジェニック作物の中で、又は、必須植物酵素（例えば、アセト乳酸シンターゼ（ＡＬＳ）、ＥＰＳＰシンターゼ、グルタミンシンターゼ（ＧＳ）又はヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ（ＨＰＰＤ））を阻害する除草剤に対して抵抗性を示すトランスジェニック作物の中で、又は、スルホニル尿素類、グリホセート類、グルホシネート類若しくはベンゾイルイソオキサゾール類及び類似した活性成分からなる群から選択される除草剤に対して抵抗性を示すトランスジェニック作物の中で、又は、これらの活性成分の任意の望ましい組合せに対して抵抗性を示すトランスジェニック植物の中で、使用することができる。

【００５３】

本発明の化合物は、特に好ましくは、グリホセート類とグルホシネート類の組合せ、グリホセート類とスルホニル尿素類又はイミダゾリノン類の組合せに対して抵抗性を示すトランスジェニック作物植物において使用することができる。本発明の化合物は、極めて特に好ましくは、例えば、Ｏｐｔｉｍｕｍ™ ＧＡＴ™（グリホセートＡＬＳ耐性）の商品名又は名称を有するトランスジェニック作物植物（例えば、トウモロコシ又はダイズ）において使用することができる。

【００５４】

トランスジェニック作物の中で本発明の活性成分を使用する場合、別の作物の中で観察される有害な植物に対する効果が生じるのみではなく、多くの場合、特定のトランスジェニック作物の中における施用に特異的な効果、例えば、防除可能な雑草の改変されたスペクトル又は特に拡大されたスペクトル、当該施用に使用し得る改変された施用量、好ましくは、そのトランスジェニック作物が抵抗性を示す除草剤との良好な組合せ可能性、並びに、そのトランスジェニック作物植物の成長及び収穫量に対する影響なども生じる。

【００５５】

従って、本発明は、さらにまた、トランスジェニック作物植物の中で有害な植物を防除するための除草剤としての、本発明による式（Ｉ）で表される化合物の使用にも関する。

【００５６】

本発明の化合物は、慣習的な製剤における水和剤、乳剤、散布可能溶液剤、散粉性製品（ｄｕｓｔｉｎｇ ｐｒｏｄｕｃｔ）又は顆粒剤の形態で使用することができる。従って、本発明は、さらにまた、本発明の化合物を含んでいる除草剤組成物及び植物成長調節性組成物も提供する。

【００５７】

本発明の化合物は、必要とされる生物学的及び／又は物理化学的パラメータに応じて、さまざまな方法で製剤することができる。可能な製剤としては、例えば、以下のものを挙げることができる：水和剤（ＷＰ）、水溶剤（ｗａｔｅｒ－ｓｏｌｕｂｌｅ ｐｏｗｄｅｒｓ）（ＳＰ）、水溶性濃厚剤（ｗａｔｅｒ－ｓｏｌｕｂｌｅ ｃｏｎｃｅｎｔｒａｔｅｓ）、乳剤（ＥＣ）、エマルション剤（ＥＷ）、例えば、水中油型エマルション剤及び油中水型エマルション剤、散布可能溶液剤（ｓｐｒａｙａｂｌｅ ｓｏｌｕｔｉｏｎｓ）、懸濁製剤（ＳＣ）、油又は水に基づく分散液剤、油混和性溶液剤、カプセル懸濁製剤（ｃａｐｓｕｌｅ ｓｕｓｐｅｎｓｉｏｎｓ）（ＣＳ）、散粉性製品（ｄｕｓｔｉｎｇ ｐｒｏｄｕｃｔｓ）（ＤＰ）、粉衣剤（ｄｒｅｓｓｉｎｇｓ）、ばらまき用顆粒剤及び土壌施用用顆粒剤、微粒剤の形態にある顆粒剤（ＧＲ）、噴霧粒剤（ｓｐｒａｙ ｇｒａｎｕｌｅｓ）、吸収粒剤（ａｂｓｏｒｐｔｉｏｎ ｇｒａｎｕｌｅｓ）及び含浸粒剤（ａｄｓｏ

ｒｐｔｉｏｎ ｇｒａｎｕｌｅｓ）、顆粒水和剤（ＷＧ）、水溶性粒剤（ＳＧ）、微量散布製剤、マイクロカプセル剤、並びに、蝋剤（ｗａｘｅｓ）。

【００５８】

これらの個々の製剤の型は原則として知られており、そして、例えば、以下のものに記載されている：「Ｗｉｎｎａｃｋｅｒ－Ｋｕｃｈｌｅｒ，“Ｃｈｅｍｉｓｃｈｅ Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｉｅ”，Ｖｏｌｕｍｅ ７，Ｃ．Ｈａｎｓｅｒ Ｖｅｒｌａｇ Ｍｕｎｉｃｈ，４ｔｈ Ｅｄ．１９８６」、「Ｗａｄｅ ｖａｎ Ｖａｌｋｅｎｂｕｒｇ，“Ｐｅｓｔｉｃｉｄｅ Ｆｏｒｍｕｌａｔｉｏｎｓ”，Ｍａｒｃｅｌ Ｄｅｋｋｅｒ，Ｎ．Ｙ．，１９７３」、「Ｋ．Ｍａｒｔｅｎｓ，“Ｓｐｒａｙ Ｄｒｙｉｎｇ”Ｈａｎｄｂｏｏｋ，３ｒｄ Ｅｄ．１９７９，Ｇ．Ｇｏｏｄｗｉｎ Ｌｔｄ．Ｌｏｎｄｏｎ」。

【００５９】

不活性物質、界面活性剤、溶媒及びさらなる添加剤などの必要とされる製剤助剤も同様に知られており、そして、例えば、以下のものに記載されている：「Ｗａｔｋｉｎｓ，“Ｈａｎｄｂｏｏｋ ｏｆ Ｉｎｓｅｃｔｉｃｉｄｅ Ｄｕｓｔ Ｄｉｌｕｅｎｔｓ ａｎｄ Ｃａｒｒｉｅｒｓ”，２ｎｄ ｅｄ．，Ｄａｒｌａｎｄ Ｂｏｏｋｓ，Ｃａｌｄｗｅｌｌ Ｎ．Ｊ．」、「Ｈ．ｖ．Ｏｌｐｈｅｎ，“Ｉｎｔｒｏｄｕｃｔｉｏｎ ｔｏ Ｃｌａｙ Ｃｏｌｌｏｉｄ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ”，２ｎｄ ｅｄ．，Ｊ．Ｗｉｌｅｙ ＆ Ｓｏｎｓ，Ｎ．Ｙ．」、「Ｃ．Ｍａｒｓｄｅｎ，“Ｓｏｌｖｅｎｔｓ Ｇｕｉｄｅ”，２ｎｄ ｅｄ．，Ｉｎｔｅｒｓｃｉｅｎｃｅ，Ｎ．Ｙ．１９６３」、「ＭｃＣｕｔｃｈｅｏｎ’ｓ“Ｄｅｔｅｒｇｅｎｔｓ ａｎｄ Ｅｍｕｌｓｉｆｉｅｒｓ Ａｎｎｕａｌ”，ＭＣ Ｐｕｂｌ．Ｃｏｒｐ．，Ｒｉｄｇｅｗｏｏｄ Ｎ．Ｊ．」、「Ｓｉｓｌｅｙ ａｎｄ Ｗｏｏｄ，“Ｅｎｃｙｃｌｏｐｅｄｉａ ｏｆ Ｓｕｒｆａｃｅ Ａｃｔｉｖｅ Ａｇｅｎｔｓ”，Ｃｈｅｍ．Ｐｕｂｌ．Ｃｏ．Ｉｎｃ．，Ｎ．Ｙ．１９６４」、「Ｓｃｈｏｎｆｅｌｄｔ，“Ｇｒｅｎｚｆｌａｃｈｅｎａｋｔｉｖｅ Ａｔｈｙｌｅｎｏｘｉｄａｄｄｕｋｔｅ”［Ｉｎｔｅｒｆａｃｅ－ａｃｔｉｖｅ Ｅｔｈｙｌｅｎｅ Ｏｘｉｄｅ Ａｄｄｕｃｔｓ］，Ｗｉｓｓ．Ｖｅｒｌａｇｓｇｅｓｅｌｌ．，Ｓｔｕｔｔｇａｒｔ １９７６」、「Ｗｉｎｎａｃｋｅｒ－Ｋｕｃｈｌｅｒ，“Ｃｈｅｍｉｓｃｈｅ Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｉｅ”，Ｖｏｌｕｍｅ ７，Ｃ．Ｈａｎｓｅｒ Ｖｅｒｌａｇ Ｍｕｎｉｃｈ，４ｔｈ ｅｄ．１９８６」。

【００６０】

水和剤は、水中で均質に分散させることが可能な調製物であり、そして、活性成分に加えて、希釈剤又は不活性物質とは別に、さらに、イオン性及び／又は非イオン性のタイプの界面活性剤（湿潤剤、分散剤）、例えば、ポリエトキシ化アルキルフェノール、ポリエトキシ化脂肪族アルコール、ポリエトキシ化脂肪族アミン、脂肪族アルコールポリグリコールエーテルスルフェート、アルカンスルホネート、アルキルベンゼンスルホネート、リグノスルホン酸ナトリウム、２，２’－ジナフチルメタン－６，６’－ジスルホン酸ナトリウム、ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウム又はオレオイルメチルタウリンナトリウムなども含んでいる。水和剤を製造するためには、例えば、ハンマーミル、ブロワミル及びエアージェットミルなどの慣習的な装置の中で、該除草活性成分を微粉砕し、そして、同時に又はその後で、製剤補助剤と混合させる。

【００６１】

乳剤は、該活性成分を有機溶媒（例えば、ブタノール、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、キシレン又は比較的沸点が高い芳香族物質若しくは炭化水素など）又はそのような有機溶媒の混合物の中に溶解させ、イオン性及び／又は非イオン性の１種類以上の界面活性剤（乳化剤）を添加することによって製造する。使用し得る乳化剤の例は、以下のものである：アルキルアリールスルホン酸カルシウム、例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム、又は、非イオン性乳化剤、例えば、脂肪酸ポリグリコールエステル、アルキルアリールポリグリコールエーテル、脂肪族アルコールポリグリコールエーテル、

プロピレンオキシド－エチレンオキシド縮合物、アルキルポリエーテル、ソルビタンエステル、例えば、ソルビタン脂肪酸エステル、又は、ポリオキシエチレンソルビタンエステル、例えば、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル。

【００６２】

散粉性粉末（ｄｕｓｔａｂｌｅ　ｐｏｗｄｅｒｓ）は、該活性成分を微粉砕された（ｆｉｎｅｌｙ　ｄｉｓｔｒｉｂｕｔｅｄ）固形物質（例えば、タルク、自然粘土、例えば、カオリン、ベントナイト及び葉ろう石、又は、珪藻土など）と一緒に粉砕することによって得られる。

【００６３】

懸濁製剤は、水性又は油性であることができる。それらは、例えば、商業用ビーズミルを用いて、そして、場合により界面活性剤（例えば、別の製剤型に関して既に上記で挙げられている界面活性剤）を添加して、湿式粉砕することによって調製することができる。

【００６４】

エマルション剤、例えば、水中油型エマルション剤（ＥＷ）は、例えば、水性有機溶媒を使用し、そして、場合により界面活性剤（例えば、別の製剤型に関して既に上記で挙げられている界面活性剤）を使用して、撹拌機、コロイドミル及び／又はスタティックミキサーを用いて調製することができる。

【００６５】

顆粒剤は、顆粒状の吸着性不活性物質の表面上に該活性成分を噴霧することによって、又は、担体（例えば、砂、カオリナイト又は顆粒状の不活性物質）の表面上に接着剤（例えば、ポリビニルアルコール、ポリアクリル酸ナトリウム）若しくは鉱油を用いて活性成分濃厚物を塗布することによって、調製することができる。さらにまた、肥料顆粒を製造するための慣習的な方法で（必用に応じて、肥料との混合物として）、適切な活性成分を造粒することも可能である。

【００６６】

顆粒水和剤は、一般に、噴霧乾燥、流動床造粒、パン造粒、高速ミキサーを用いた混合、及び、固形不活性物質を用いない押出などの、慣習的な方法によって調製する。

【００６７】

パン粒剤、流動床粒剤、押出粒剤及び噴霧粒剤の製造に関しては、例えば、「“Ｓｐｒａｙ　Ｄｒｙｉｎｇ　Ｈａｎｄｂｏｏｋ”　３ｒｄ　Ｅｄ．　１９７９，　Ｇ．Ｇｏｏｄｗｉｎ　Ｌｔｄ．，　Ｌｏｎｄｏｎ」、「Ｊ．Ｅ．Ｂｒｏｗｎｉｎｇ，“Ａｇｇｌｏｍｅｒａｔｉｏｎ”，　Ｃｈｅｍｉｃａｌ　ａｎｄ　Ｅｎｇｉｎｅｅｒｉｎｇ　１９６７，　ｐａｇｅｓ　１４７　ｆｆ」、「“Ｐｅｒｒｙ’ｓ　Ｃｈｅｍｉｃａｌ　Ｅｎｇｉｎｅｅｒ’ｓ　Ｈａｎｄｂｏｏｋ”，　５ｔｈ　ｅｄ．，　ＭｃＧｒａｗ－Ｈｉｌｌ，　Ｎｅｗ　Ｙｏｒｋ　１９７３，　ｐｐ．８－５７」に記載されている方法を参照されたい。

【００６８】

作物保護組成物の製剤に関するさらなる詳細については、例えば、「Ｇ．Ｃ．Ｋｌｉｎｇｍａｎ，“Ｗｅｅｄ　Ｃｏｎｔｒｏｌ　ａｓ　ａ　Ｓｃｉｅｎｃｅ”，　Ｊｏｈｎ　Ｗｉｌｅｙ　ａｎｄ　Ｓｏｎｓ，　Ｉｎｃ．，　Ｎｅｗ　Ｙｏｒｋ，　１９６１，　ｐａｇｅｓ　８１－９６」及び「Ｊ．Ｄ．Ｆｒｅｙｅｒ，　Ｓ．Ａ．Ｅｖａｎｓ，“Ｗｅｅｄ　Ｃｏｎｔｒｏｌ　Ｈａｎｄｂｏｏｋ”，　５ｔｈ　Ｅｄ．，　Ｂｌａｃｋｗｅｌｌ　Ｓｃｉｅｎｔｉｆｉｃ　Ｐｕｂｌｉｃａｔｉｏｎｓ，　Ｏｘｆｏｒｄ，　１９６８，　ｐａｇｅｓ　１０１－１０３」を参照されたい。

【００６９】

該農薬調製物は、一般に、０．１～９９重量％、特に、０．１～９５重量％の本発明化合物を含有する。

【００７０】

水和剤では、該活性成分の濃度は、例えば、約１０重量％～９０重量％であり、１００重量％までの残余は、慣習的な製剤成分からなる。乳剤では、該活性成分の濃度は、約１重量％～９０重量％、好ましくは５重量％～８０重量％であり得る。粉剤のタイプの製剤

は、１重量％～３０重量％の活性成分、好ましくは、通常、５重量％～２０重量％の活性成分を含み；散布可能溶液剤は、約０．０５重量％～８０重量％、好ましくは、２重量％～５０重量％の活性成分を含む。顆粒水和剤の場合は、該活性成分の含有量は、当該活性化合物が液体形態で存在しているか又は固体形態で存在しているかに部分的に依存し、及び、どのような造粒助剤、増量剤などが使用されるかに部分的に左右される。水中で分散可能な顆粒剤では、活性成分の含有量は、例えば、１重量％～９５重量％、好ましくは１０～８０重量％である。

【００７１】

さらに、活性成分の上記製剤は、場合により、それぞれの慣習的な粘着剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、浸透剤、防腐剤、不凍剤、並びに、溶媒、増量剤、担体、並びに、色素、消泡剤、蒸発抑制剤、並びに、ｐＨ及び粘度に影響を及ぼす作用剤を含有する。

【００７２】

施用するために、商業用の形態にある製剤は、適切な場合には、慣習的な方法で希釈し、例えば、水和剤、乳剤、分散液剤及び顆粒水和剤の場合には、水で希釈する。粉剤のタイプの製剤、土壌施用用顆粒剤又はばらまき用顆粒剤及び散布可能溶液剤は、通常、施用前に別の不活性物質でさらに希釈することはない。

【００７３】

式（Ｉ）で表される化合物の必要とされる施用量は、外部条件（例えば、温度、湿度及び使用する除草剤の種類など）に応じて変わる。それは、広い範囲内で、例えば、０．００１～１．０ｋｇ／ｈａ又はそれ以上の活性物質の範囲内で、変わり得る。しかしながら、それは、好ましくは、０．００５～７５０ｇ／ｈａである。

【実施例】

【００７４】

下記実施例によって、本発明について例証する。

【００７５】

Ａ．　化学的実施例

４－シクロプロピル－２－メチル－３－（メチルスルフィニル）－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－イル）ベンズアミド（実施例Ｎｏ．１－２）

段階１：　１－ブロモ－３－フルオロ－２－（メチルスルファニル）ベンゼンの合成

ｎ－ヘキサンの中のｎ－ブチルリチウムの２．５Ｍ（２．５７ｍｏｌ）溶液１０２８ｍＬを１６００ｍＬの乾燥ＴＨＦに溶解させた。０℃で、４００ｍＬ（２．８３ｍｏｌ）のジイソプロピルアミンを添加した。その反応混合物をその温度で１５分間撹拌した。次いで、その混合物を－７８℃まで冷却した。その温度で、２８７ｍＬ（２．５７ｍｏｌ）の１－ブロモ－３－フルオロベンゼンを滴下して加えた。その混合物をその温度で１時間撹拌した。その後、２５４ｍＬ（２．８２ｍｏｌ）のジメチルジスルフィドを添加した。次いで、その反応混合物を室温（ＲＴ）まで昇温させた。水性の後処理に付した後、その有機相の残渣を０．５ｍｂａｒでの分別蒸留に付した。８７℃で、５０４ｇの所望の生成物が得られた。

【００７６】

段階２：　４－ブロモ－２－フルオロ－３－（メチルスルファニル）安息香酸の合成

１７６ｍＬ（１．２４ｍｏｌ）のジイソプロピルアミンを５５０ｍＬの乾燥ＴＨＦに溶解させた溶液に、－７８℃で、ｎ－ヘキサン中のｎ－ブチルリチウムの２．５Ｍ（１．１３ｍｏｌ）溶液４５２ｍＬを滴下して加えた。その溶液をその温度で５分間撹拌し、次いで、０℃で１５分間撹拌した。その後、その溶液を－７８℃まで冷却した。次いで、２５０ｇ（１．１３ｍｏｌ）の１－ブロモ－３－フルオロ－２－（メチルスルファニル）ベンゼンを１５０ｍＬの乾燥ＴＨＦに溶解させた溶液を滴下して加えた。その溶液を－７８℃で１．５時間撹拌した。その後、２９８ｇ（６．７８ｍｏｌ）の二酸化炭素をドライアイスの形態で添加した。その反応混合物をＲＴまでゆっくりと昇温させた。後処理のために、その混合物を希塩酸を用いて酸性化してｐＨ＝１とした。次いで、その生成物をジエチルエーテルで６回抽出した。その有機相を合して飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄した。

次いで、その生成物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で３回抽出した。その水性抽出物を合してｐＨ＝９でジエチルエーテルで３回洗浄し、次いで、濃塩酸を用いてゆっくりと酸性化してｐＨ＝１とした。その生成物をジエチルエーテルで３回抽出し、その有機相を合して飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄した。最後に、その有機相を合して硫酸マグネシウムで脱水し、その濾液から溶媒を除去した。さらに精製するために、その生成物を水から再結晶させ、２７５ｇの所望の生成物が得られた。

【００７７】

段階３：　４－ブロモ－２－フルオロ－Ｎ－（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－３－（メチルスルファニル）ベンズアミドの合成

１０００ｍＬの乾燥ジクロロメタンの中の３４０ｇ（１．２８ｍｏｌ）の４－ブロモ－２－フルオロ－３－（メチルスルファニル）安息香酸に２ｍＬのＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミドを添加し、次いで、その混合物を３５℃の温度になるまで加熱した。その温度で、２７１ｍＬ（３．２０ｍｏｌ）の塩化オキサリルをゆっくりと滴下して加えた。ガスの発生が止んだとき、その反応混合物を、当該反応のモニタリングが出発物質を示さなくなるまで、環流しながら加熱した。次いで、その混合物から溶媒を除去した。その残渣に６００ｍＬのトルエンを添加し、その混合物から再度溶媒を除去した。その酸塩化物を取って６００ｍＬの無水ジクロロメタンの中に入れた。５℃－２５℃で、この溶液を３０５ｍＬ（３．２０ｍｏｌ）の２－アミノ－２－メチルプロパン－１－オールと１００ｍＬの無水ジクロロメタンの混合物に滴下して加えた。その反応混合物を０℃で１．５時間撹拌し、次いで、室温で１６時間撹拌した。後処理のために、その混合物を濾過し、その濾液から溶媒を除去した。得られた残渣は、３３０ｇの生成物であった。これは、それ以上精製することなく、次の段階で使用し。

【００７８】

段階４：　２－［４－ブロモ－２－フルオロ－３－（メチルスルファニル）フェニル］－４，４－ジメチル－４，５－ジヒドロ－１，３－オキサゾールの合成

３３０ｇ（０．９８ｍｏｌ）の４－ブロモ－２－フルオロ－Ｎ－（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）－３－（メチルスルファニル）ベンズアミドに、ＲＴで、３８４ｍＬ（５．３ｍｏｌ）の塩化チオニルを添加した。ガスの発生が止んだとき、その反応混合物をＲＴで１時間撹拌した。後処理のために、その混合物を注意深く水の中に注ぎ入れた。次いで、その混合物をジエチルエーテルで抽出した。その水相を０℃まで冷却し、２０％水酸化ナトリウム溶液を用いてアルカリ化した。次いで、その混合物を、即座に且つ迅速に、ジクロロメタンで抽出した。その有機相を脱水し、その濾液から溶媒を除去した。その粗製生成物をジイソプロピルエーテルから再結晶させて、１６５ｇの所望の生成物が単離された。

【００７９】

段階５：　２－［４－ブロモ－２－メチル－３－（メチルスルファニル）フェニル］－４，４－ジメチル－４，５－ジヒドロ－１，３－オキサゾールの合成

４４０ｍＬの乾燥ジエチルエーテルの中の４５ｇ（１４１ｍｍｏｌ）の２－［４－ブロモ－２－フルオロ－３－（メチルスルファニル）フェニル］－４，４－ジメチル－４，５－ジヒドロ－１，３－オキサゾールに、ＲＴで、保護ガス下、ヨウ化メチルマグネシウム（１２．３７ｇ（５０７ｍｍｏｌ）のマグネシウムと７１．２４ｇ（５０１ｍｍｏｌ）のヨードメタンから新たに調製したもの）をゆっくりと滴下して加えた。確実に、温度が３０℃を超えて上昇することのないようにした。その後、その混合物を、当該反応のモニタリングが出発物質を示さなくなるまで、ＲＴで撹拌した。後処理のために、その混合物を氷と希塩酸の混合物の中にゆっくりと注ぎ入れた。次いで、ｐＨが７と８の間になるまで、水酸化ナトリウム溶液を添加した。その水相をジエチルエーテルで２回抽出した。その有機相を合して脱水し、その濾液から溶媒を除去した。その残渣をジイソプロピルエーテルから再結晶させて、３８ｇの所望の生成物が得られた。

【００８０】

段階６：　４－ブロモ－２－メチル－３－（メチルスルファニル）安息香酸の合成

２５０ｇ（０．８ｍｏｌ）の２－［４－ブロモ－２－メチル－３－（メチルスルファニル）フェニル］－４，４－ジメチル－４，５－ジヒドロ－１，３－オキサゾールに、１３００ｍＬの６Ｍ　塩酸を添加した。その反応混合物を環流しながら２４時間加熱した。後処理のために、その混合物をアルカリ化し、ジエチルエーテルで２回洗浄した。その水相を塩酸を用いて酸性化した。生成物が結晶化した。その混合物を濾過した。残渣として、１６７ｇの所望の生成物が得られた。

【００８１】

段階７：　４－ブロモ－２－メチル－３－（メチルスルファニル）安息香酸メチルの合成

１００ｍＬのメタノールの中の１０．１ｇ（３８．７ｍｍｏｌ）の４－ブロモ－２－メチル－３－（メチルスルファニル）安息香酸に５ｍＬの濃硫酸を添加した。次いで、その混合物を環流しながら８時間加熱した。その混合物をＲＴまで冷却し、溶媒を除去した。その残渣を取って水の中に入れ、氷浴の中で冷却した。その混合物を濾過し、その残渣を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄した。その残渣を乾燥させて、９．８２ｇの所望の生成物が得られた。

【００８２】

段階８：　４－シクロプロピル－２－メチル－３－（メチルスルファニル）安息香酸（実施例Ｎｏ．９－１）の合成

１．９４ｇ（８０．０ｍｍｏｌ）のマグネシウム削りくずに、保護ガス下、５ｍＬの乾燥テトラヒドロフランを添加した。次いで、グリニャール反応を開始させるために、合計で９．６７ｇ（８０．０ｍｍｏｌ）の臭化シクロプロピルのうちの少量及び触媒量のヨウ素を添加した。そのグリニャール反応が始まった後、臭化シクロプロピルの残部を１４５ｍＬの乾燥テトラヒドロフランで予め稀釈しておいたものをゆっくりと滴下して加えた。次いで、その反応を完了させるために、その混合物を環流しながら１５分間加熱した。その内容物をＲＴまで冷却し、次いで、８００ｍｇ（１８．９ｍｍｏｌ）の塩化リチウムを添加した。塩化リチウムが溶解した後、直ちに、その混合物を－２０℃まで冷却した。次いで、塩化亜鉛を乾燥テトラヒドロフランに溶解させた溶液１１４ｍＬ（０．７Ｍ；７９．８ｍｍｏｌ）をゆっくりと滴下して加えた。その温度で、その混合物をさらに１５分間撹拌した。次いで、その内容物をＲＴまで昇温させ、そして、酸素を除去するために、減圧にすること及び反応フラスコ内にアルゴンを通気させることを繰り返し行った。その混合物に、１０．０ｇ（３６．３ｍｍｏｌ）の４－ブロモ－２－メチル－３－（メチルスルファニル）安息香酸メチルと２．３５ｇ（２．０４ｍｍｏｌ）のテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を２００ｍＬの乾燥テトラヒドロフランに溶解させた溶液（これは、最初に、当該置換されている安息香酸エステルを溶解させ、減圧にすること及び容器内にアルゴンを通気させることを繰り返し行って酸素を除去し、次いで、当該パラジウム触媒を添加し、最後に、再度、減圧にすること及びアルゴンを通気させることを繰り返し行って酸素を除去することによって、調製した）を添加した。その反応混合物を環流しながら３時間加熱し、次いで、ＲＴまで冷却した。その反応を完了させるために、上記量の半分の量のグリニャール試薬を再度調製し、同様に、該塩化亜鉛溶液と反応させた。上記で記載したように酸素を除去した後、クロスカップリング混合物に該量のカップリング試薬を添加した。さらに、上記量の半分の量のパラジウム触媒も添加した。その反応混合物を、再度、２時間後に出発物質が検出されなくなるまで、環流しながら加熱した。後処理のために、その内容物をＲＴまで冷却し、５００ｍＬの飽和塩化アンモニウム水溶液を添加した。その混合物をジエチルエーテルで２回抽出した。その有機相を合して脱水し、濾過し、そして、最後に、生成物も失われることのないように充分に注意しながら溶媒を除去した。その残渣を１００ｍＬのメタノールに溶解させ、１０ｍＬの２０％水酸化ナトリウム溶液を添加した。その混合物をＲＴで１６時間撹拌し、次いで、６０℃で３時間撹拌した。その後、その反応混合物を、当該反応のモニタリングが出発物質を示さなくなるまで、環流しながら加熱した。その混合物を濃縮し、その残渣を取って水の中に入れた。その混合物をジクロロメタンで洗浄し、その水相をセライトで濾過した。その濾液

を６Ｍ　塩酸を用いて酸性化し、ジクロロメタンで３回抽出した。その有機相を合して脱水し、その濾液を体積が約半分になるまで濃縮した。その残渣を１０％水酸化ナトリウム溶液で３回抽出した。その水相を合して６Ｍ　塩酸を用いて酸性化し、氷浴の中で撹拌し、そして、生成物が沈澱した。その混合物を濾過し、乾燥させた。７．３１ｇの所望の生成物が得られた。

【００８３】

段階９：　４－シクロプロピル－２－メチル－３－（メチルスルファニル）－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－イル）ベンズアミド（実施例Ｎｏ．１－１）の合成

１０ｍＬのピリジンの中の３３０ｍｇ（１．４８ｍｍｏｌ）の４－シクロプロピル－２－メチル－３－（メチルスルファニル）安息香酸と１９１ｍｇ（純度９８％；１．８９ｍｍｏｌ）の５－アミノ－１－メチル－１Ｈ－テトラゾールに、２６４ｍｇ（２．０８ｍｍｏｌ）の塩化オキサリルを添加した。その混合物をＲＴで１５分間撹拌し、次いで、５０℃で２時間撹拌した。その変換を完了させるために、その混合物をＲＴまで冷却し、上記量の４分の１の量の追加の塩化オキサリルを添加した。その混合物を５０℃でさらに２時間撹拌した。後処理のために、その混合物から溶媒を除去した。その残渣を取ってジクロロメタンと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液の中に入れ、撹拌した。相分離後、その有機相から溶媒を除去した。その残渣を取ってトルエンの中に入れ、その混合物を再度濃縮した。その残渣をクロマトグラフィーで精製して、３２０ｍｇの所望の生成物が単離された。

【００８４】

段階１０：　４－シクロプロピル－２－メチル－３－（メチルスルフィニル）－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－イル）ベンズアミド（実施例Ｎｏ．１－２）の合成

１０ｍＬの氷酢酸の中の１０７ｍｇ（０．３５ｍｍｏｌ）の４－シクロプロピル－２－メチル－３－（メチルスルファニル）－Ｎ－（１－メチル－１Ｈ－テトラゾール－５－イル）ベンズアミドに、室温で、３４．３ｍｇ（３５％；０．３５ｍｍｏｌ）の過酸化水素水溶液を添加した。その反応混合物を、当該反応のモニタリングが出発物質を示さなくなるまで、ＲＴで撹拌した。後処理のために、過酸化物が検出されなくなるまで、固形メタ重亜硫酸ナトリウムを添加した。その混合物から溶媒を除去し、その残渣を取って少量の水の中に入れた。１Ｍ　塩酸を添加した後、その混合物を１０分間撹拌し、次いで、濾過した。その残渣を乾燥させて、８０．４ｍｇの所望の生成物が得られた。

【００８５】

下記表中に挙げられている化合物は、極めて特に好ましい。

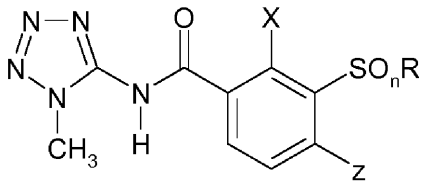
【００８６】

使用されている略語は、下記を意味する：

Ｍｅ　＝　メチル
Ｅｔ　＝　エチル
Ｐｒ　＝　プロピル
ｃ－Ｐｒ　＝　シクロプロピル。

【表１】

表１：一般式（Ｉ）〔式中、QはQ1であり、及び、R^Xはメチル基である〕で表される本発明化合物



No.	X	n	R	Z
1-1	Me	0	Me	c-Pr
1-2	Me	1	Me	c-Pr
1-3	Me	2	Me	c-Pr
1-4	Me	0	Et	c-Pr
1-5	Me	1	Et	c-Pr
1-6	Me	2	Et	c-Pr
1-7	Me	0	c-Pr	c-Pr
1-8	Me	1	c-Pr	c-Pr
1-9	Me	2	c-Pr	c-Pr
1-10	Me	0	CH_2c-Pr	c-Pr
1-11	Me	1	CH_2c-Pr	c-Pr
1-12	Me	2	CH_2c-Pr	c-Pr
1-13	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
1-14	Me	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
1-15	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr

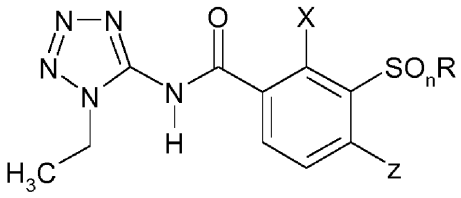
No.	X	n	R	Z
1-16	Me	0	Me	c-Bu
1-17	Me	1	Me	c-Bu
1-18	Me	2	Me	c-Bu
1-19	Me	0	Et	c-Bu
1-20	Me	1	Et	c-Bu
1-21	Me	2	Et	c-Bu
1-22	Me	0	c-Pr	c-Bu
1-23	Me	1	c-Pr	c-Bu
1-24	Me	2	c-Pr	c-Bu
1-25	Me	0	CH_2c-Pr	c-Bu
1-26	Me	1	CH_2c-Pr	c-Bu
1-27	Me	2	CH_2c-Pr	c-Bu
1-28	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
1-29	Me	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
1-30	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
1-31	Et	0	Me	c-Pr
1-32	Et	1	Me	c-Pr
1-33	Et	2	Me	c-Pr
1-34	Et	0	Et	c-Pr
1-35	Et	1	Et	c-Pr
1-36	Et	2	Et	c-Pr
1-37	Et	0	c-Pr	c-Pr
1-38	Et	1	c-Pr	c-Pr
1-39	Et	2	c-Pr	c-Pr
1-40	Et	0	CH_2c-Pr	c-Pr
1-41	Et	1	CH_2c-Pr	c-Pr
1-42	Et	2	CH_2c-Pr	c-Pr
1-43	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
1-44	Et	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
1-45	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
1-46	Et	0	Me	c-Bu
1-47	Et	1	Me	c-Bu
1-48	Et	2	Me	c-Bu
1-49	Et	0	Et	c-Bu
1-50	Et	1	Et	c-Bu
1-51	Et	2	Et	c-Bu

No.	X	n	R	Z
1-52	Et	0	c-Pr	c-Bu
1-53	Et	1	c-Pr	c-Bu
1-54	Et	2	c-Pr	c-Bu
1-55	Et	0	CH_2c-Pr	c-Bu
1-56	Et	1	CH_2c-Pr	c-Bu
1-57	Et	2	CH_2c-Pr	c-Bu
1-58	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
1-59	Et	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
1-60	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
1-61	c-Pr	0	Me	c-Pr
1-62	c-Pr	1	Me	c-Pr
1-63	c-Pr	2	Me	c-Pr
1-64	c-Pr	0	Et	c-Pr
1-65	c-Pr	1	Et	c-Pr
1-66	c-Pr	2	Et	c-Pr
1-67	c-Pr	0	c-Pr	c-Pr
1-68	c-Pr	1	c-Pr	c-Pr
1-69	c-Pr	2	c-Pr	c-Pr
1-70	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Pr
1-71	c-Pr	1	CH_2c-Pr	c-Pr
1-72	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Pr
1-73	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
1-74	c-Pr	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
1-75	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
1-76	c-Pr	0	Me	c-Bu
1-77	c-Pr	1	Me	c-Bu
1-78	c-Pr	2	Me	c-Bu
1-79	c-Pr	0	Et	c-Bu
1-80	c-Pr	1	Et	c-Bu
1-81	c-Pr	2	Et	c-Bu
1-82	c-Pr	0	c-Pr	c-Bu
1-83	c-Pr	1	c-Pr	c-Bu
1-84	c-Pr	2	c-Pr	c-Bu
1-85	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Bu
1-86	c-Pr	1	CH_2c-Pr	c-Bu
1-87	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Bu

No.	X	n	R	Z
1-88	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
1-89	c-Pr	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
1-90	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu

【表２】

表２：一般式（Ｉ）〔式中、QはQ1であり、及び、R^xはエチル基である〕で表される本発明化合物



No.	X	n	R	Z
2-1	Me	0	Me	c-Pr
2-2	Me	1	Me	c-Pr
2-3	Me	2	Me	c-Pr
2-4	Me	0	Et	c-Pr
2-5	Me	1	Et	c-Pr
2-6	Me	2	Et	c-Pr
2-7	Me	0	c-Pr	c-Pr
2-8	Me	1	c-Pr	c-Pr
2-9	Me	2	c-Pr	c-Pr
2-10	Me	0	CH_2c-Pr	c-Pr
2-11	Me	1	CH_2c-Pr	c-Pr
2-12	Me	2	CH_2c-Pr	c-Pr
2-13	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
2-14	Me	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
2-15	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
2-16	Me	0	Me	c-Bu
2-17	Me	1	Me	c-Bu
2-18	Me	2	Me	c-Bu
2-19	Me	0	Et	c-Bu
2-20	Me	1	Et	c-Bu
2-21	Me	2	Et	c-Bu

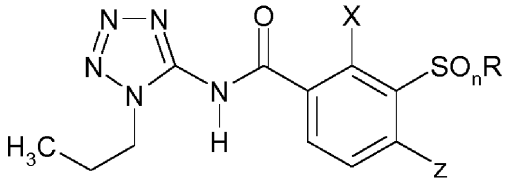
No.	X	n	R	Z
2-22	Me	0	c-Pr	c-Bu
2-23	Me	1	c-Pr	c-Bu
2-24	Me	2	c-Pr	c-Bu
2-25	Me	0	CH_2c-Pr	c-Bu
2-26	Me	1	CH_2c-Pr	c-Bu
2-27	Me	2	CH_2c-Pr	c-Bu
2-28	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
2-29	Me	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
2-30	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
2-31	Et	0	Me	c-Pr
2-32	Et	1	Me	c-Pr
2-33	Et	2	Me	c-Pr
2-34	Et	0	Et	c-Pr
2-35	Et	1	Et	c-Pr
2-36	Et	2	Et	c-Pr
2-37	Et	0	c-Pr	c-Pr
2-38	Et	1	c-Pr	c-Pr
2-39	Et	2	c-Pr	c-Pr
2-40	Et	0	CH_2c-Pr	c-Pr
2-41	Et	1	CH_2c-Pr	c-Pr
2-42	Et	2	CH_2c-Pr	c-Pr
2-43	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
2-44	Et	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
2-45	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
2-46	Et	0	Me	c-Bu
2-47	Et	1	Me	c-Bu
2-48	Et	2	Me	c-Bu
2-49	Et	0	Et	c-Bu
2-50	Et	1	Et	c-Bu
2-51	Et	2	Et	c-Bu
2-52	Et	0	c-Pr	c-Bu
2-53	Et	1	c-Pr	c-Bu
2-54	Et	2	c-Pr	c-Bu
2-55	Et	0	CH_2c-Pr	c-Bu
2-56	Et	1	CH_2c-Pr	c-Bu
2-57	Et	2	CH_2c-Pr	c-Bu

【００８７】

No.	X	n	R	Z
2-58	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
2-59	Et	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
2-60	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
2-61	c-Pr	0	Me	c-Pr
2-62	c-Pr	1	Me	c-Pr
2-63	c-Pr	2	Me	c-Pr
2-64	c-Pr	0	Et	c-Pr
2-65	c-Pr	1	Et	c-Pr
2-66	c-Pr	2	Et	c-Pr
2-67	c-Pr	0	c-Pr	c-Pr
2-68	c-Pr	1	c-Pr	c-Pr
2-69	c-Pr	2	c-Pr	c-Pr
2-70	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Pr
2-71	c-Pr	1	CH_2c-Pr	c-Pr
2-72	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Pr
2-73	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
2-74	c-Pr	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
2-75	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
2-76	c-Pr	0	Me	c-Bu
2-77	c-Pr	1	Me	c-Bu
2-78	c-Pr	2	Me	c-Bu
2-79	c-Pr	0	Et	c-Bu
2-80	c-Pr	1	Et	c-Bu
2-81	c-Pr	2	Et	c-Bu
2-82	c-Pr	0	c-Pr	c-Bu
2-83	c-Pr	1	c-Pr	c-Bu
2-84	c-Pr	2	c-Pr	c-Bu
2-85	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Bu
2-86	c-Pr	1	CH_2c-Pr	c-Bu
2-87	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Bu
2-88	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
2-89	c-Pr	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
2-90	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu

【表３】

表３：一般式（Ｉ）〔式中、QはQ1であり、及び、R^xはn-プロピル基である〕で表される本発明化合物



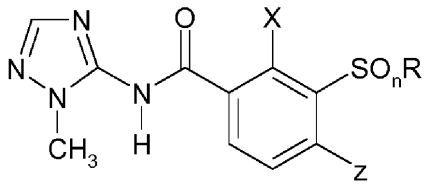
No.	X	n	R	Z
3-1	Me	0	Me	c-Pr
3-2	Me	1	Me	c-Pr
3-3	Me	2	Me	c-Pr
3-4	Me	0	Et	c-Pr
3-5	Me	1	Et	c-Pr
3-6	Me	2	Et	c-Pr
3-7	Me	0	c-Pr	c-Pr
3-8	Me	1	c-Pr	c-Pr
3-9	Me	2	c-Pr	c-Pr
3-10	Me	0	CH_2c-Pr	c-Pr
3-11	Me	1	CH_2c-Pr	c-Pr
3-12	Me	2	CH_2c-Pr	c-Pr
3-13	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
3-14	Me	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
3-15	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
3-16	Me	0	Me	c-Bu
3-17	Me	1	Me	c-Bu
3-18	Me	2	Me	c-Bu
3-19	Me	0	Et	c-Bu
3-20	Me	1	Et	c-Bu
3-21	Me	2	Et	c-Bu
3-22	Me	0	c-Pr	c-Bu
3-23	Me	1	c-Pr	c-Bu
3-24	Me	2	c-Pr	c-Bu
3-25	Me	0	CH_2c-Pr	c-Bu
3-26	Me	1	CH_2c-Pr	c-Bu
3-27	Me	2	CH_2c-Pr	c-Bu
3-28	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
3-29	Me	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu

No.	X	n	R	Z
3-30	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
3-31	Et	0	Me	c-Pr
3-32	Et	1	Me	c-Pr
3-33	Et	2	Me	c-Pr
3-34	Et	0	Et	c-Pr
3-35	Et	1	Et	c-Pr
3-36	Et	2	Et	c-Pr
3-37	Et	0	c-Pr	c-Pr
3-38	Et	1	c-Pr	c-Pr
3-39	Et	2	c-Pr	c-Pr
3-40	Et	0	CH_2c-Pr	c-Pr
3-41	Et	1	CH_2c-Pr	c-Pr
3-42	Et	2	CH_2c-Pr	c-Pr
3-43	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
3-44	Et	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
3-45	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
3-46	Et	0	Me	c-Bu
3-47	Et	1	Me	c-Bu
3-48	Et	2	Me	c-Bu
3-49	Et	0	Et	c-Bu
3-50	Et	1	Et	c-Bu
3-51	Et	2	Et	c-Bu
3-52	Et	0	c-Pr	c-Bu
3-53	Et	1	c-Pr	c-Bu
3-54	Et	2	c-Pr	c-Bu
3-55	Et	0	CH_2c-Pr	c-Bu
3-56	Et	1	CH_2c-Pr	c-Bu
3-57	Et	2	CH_2c-Pr	c-Bu
3-58	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
3-59	Et	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
3-60	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
3-61	c-Pr	0	Me	c-Pr
3-62	c-Pr	1	Me	c-Pr
3-63	c-Pr	2	Me	c-Pr
3-64	c-Pr	0	Et	c-Pr
3-65	c-Pr	1	Et	c-Pr

No.	X	n	R	Z
3-66	c-Pr	2	Et	c-Pr
3-67	c-Pr	0	c-Pr	c-Pr
3-68	c-Pr	1	c-Pr	c-Pr
3-69	c-Pr	2	c-Pr	c-Pr
3-70	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Pr
3-71	c-Pr	1	CH_2c-Pr	c-Pr
3-72	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Pr
3-73	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
3-74	c-Pr	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
3-75	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
3-76	c-Pr	0	Me	c-Bu
3-77	c-Pr	1	Me	c-Bu
3-78	c-Pr	2	Me	c-Bu
3-79	c-Pr	0	Et	c-Bu
3-80	c-Pr	1	Et	c-Bu
3-81	c-Pr	2	Et	c-Bu
3-82	c-Pr	0	c-Pr	c-Bu
	c-Pr	1	c-Pr	c-Bu
3-83	c-Pr	2	c-Pr	c-Bu
3-84	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Bu
3-85	c-Pr	1	CH_2c-Pr	c-Bu
3-86	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Bu
3-87	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
3-88	c-Pr	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
3-89	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu

【表４】

表４：一般式（Ｉ）〔式中、QはQ2であり、及び、R^Xはメチル基である〕で表される本発明化合物



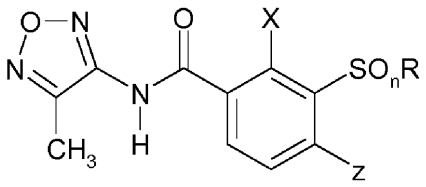
No.	X	n	R	Z
4-1	Me	0	Me	c-Pr
4-2	Me	1	Me	c-Pr
4-3	Me	2	Me	c-Pr
4-4	Me	0	Et	c-Pr
4-5	Me	1	Et	c-Pr
4-6	Me	2	Et	c-Pr
4-7	Me	0	c-Pr	c-Pr
4-8	Me	1	c-Pr	c-Pr
4-9	Me	2	c-Pr	c-Pr
4-10	Me	0	CH_2c-Pr	c-Pr
4-11	Me	1	CH_2c-Pr	c-Pr
4-12	Me	2	CH_2c-Pr	c-Pr
4-13	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
4-14	Me	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
4-15	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
4-16	Me	0	Me	c-Bu
4-17	Me	1	Me	c-Bu
4-18	Me	2	Me	c-Bu
4-19	Me	0	Et	c-Bu
4-20	Me	1	Et	c-Bu
4-21	Me	2	Et	c-Bu
4-22	Me	0	c-Pr	c-Bu
4-23	Me	1	c-Pr	c-Bu
4-24	Me	2	c-Pr	c-Bu
4-25	Me	0	CH_2c-Pr	c-Bu
4-26	Me	1	CH_2c-Pr	c-Bu
4-27	Me	2	CH_2c-Pr	c-Bu
4-28	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
4-29	Me	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu

No.	X	n	R	Z
4-30	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
4-31	Et	0	Me	c-Pr
4-32	Et	1	Me	c-Pr
4-33	Et	2	Me	c-Pr
4-34	Et	0	Et	c-Pr
4-35	Et	1	Et	c-Pr
4-36	Et	2	Et	c-Pr
4-37	Et	0	c-Pr	c-Pr
4-38	Et	1	c-Pr	c-Pr
4-39	Et	2	c-Pr	c-Pr
4-40	Et	0	CH_2c-Pr	c-Pr
4-41	Et	1	CH_2c-Pr	c-Pr
4-42	Et	2	CH_2c-Pr	c-Pr
4-43	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
4-44	Et	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
4-45	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
4-46	Et	0	Me	c-Bu
4-47	Et	1	Me	c-Bu
4-48	Et	2	Me	c-Bu
4-49	Et	0	Et	c-Bu
4-50	Et	1	Et	c-Bu
4-51	Et	2	Et	c-Bu
4-52	Et	0	c-Pr	c-Bu
4-53	Et	1	c-Pr	c-Bu
4-54	Et	2	c-Pr	c-Bu
4-55	Et	0	CH_2c-Pr	c-Bu
4-56	Et	1	CH_2c-Pr	c-Bu
4-57	Et	2	CH_2c-Pr	c-Bu
4-58	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
4-59	Et	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
4-60	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
4-61	c-Pr	0	Me	c-Pr
4-62	c-Pr	1	Me	c-Pr
4-63	c-Pr	2	Me	c-Pr
4-64	c-Pr	0	Et	c-Pr
4-65	c-Pr	1	Et	c-Pr

No.	X	n	R	Z
4-66	c-Pr	2	Et	c-Pr
4-67	c-Pr	0	c-Pr	c-Pr
4-68	c-Pr	1	c-Pr	c-Pr
4-69	c-Pr	2	c-Pr	c-Pr
4-70	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Pr
4-71	c-Pr	1	CH_2c-Pr	c-Pr
4-72	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Pr
4-73	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
4-74	c-Pr	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
4-75	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
4-76	c-Pr	0	Me	c-Bu
4-77	c-Pr	1	Me	c-Bu
4-78	c-Pr	2	Me	c-Bu
4-79	c-Pr	0	Et	c-Bu
4-80	c-Pr	1	Et	c-Bu
4-81	c-Pr	2	Et	c-Bu
4-82	c-Pr	0	c-Pr	c-Bu
4-83	c-Pr	1	c-Pr	c-Bu
4-84	c-Pr	2	c-Pr	c-Bu
4-85	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Bu
4-86	c-Pr	1	CH_2c-Pr	c-Bu
4-87	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Bu
4-88	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
4-89	c-Pr	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
4-90	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu

【表５】

表５：一般式（Ｉ）〔式中、QはQ3であり、及び、R^yはメチル基である〕で表される本発明化合物



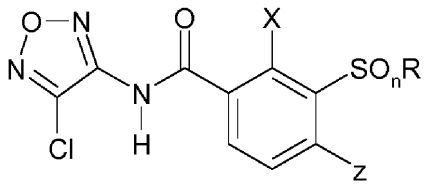
No.	X	n	R	Z
5-1	Me	0	Me	c-Pr
5-2	Me	1	Me	c-Pr
5-3	Me	2	Me	c-Pr
5-4	Me	0	Et	c-Pr
5-5	Me	1	Et	c-Pr
5-6	Me	2	Et	c-Pr
5-7	Me	0	c-Pr	c-Pr
5-8	Me	1	c-Pr	c-Pr
5-9	Me	2	c-Pr	c-Pr
5-10	Me	0	CH_2c-Pr	c-Pr
5-11	Me	1	CH_2c-Pr	c-Pr
5-12	Me	2	CH_2c-Pr	c-Pr
5-13	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
5-14	Me	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
5-15	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
5-16	Me	0	Me	c-Bu
5-17	Me	1	Me	c-Bu
5-18	Me	2	Me	c-Bu
5-19	Me	0	Et	c-Bu
5-20	Me	1	Et	c-Bu
5-21	Me	2	Et	c-Bu
5-22	Me	0	c-Pr	c-Bu
5-23	Me	1	c-Pr	c-Bu
5-24	Me	2	c-Pr	c-Bu
5-25	Me	0	CH_2c-Pr	c-Bu
5-26	Me	1	CH_2c-Pr	c-Bu
5-27	Me	2	CH_2c-Pr	c-Bu
5-28	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
5-29	Me	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu

No.	X	n	R	Z
5-30	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
5-31	Et	0	Me	c-Pr
5-32	Et	1	Me	c-Pr
5-33	Et	2	Me	c-Pr
5-34	Et	0	Et	c-Pr
5-35	Et	1	Et	c-Pr
5-36	Et	2	Et	c-Pr
5-37	Et	0	c-Pr	c-Pr
5-38	Et	1	c-Pr	c-Pr
5-39	Et	2	c-Pr	c-Pr
5-40	Et	0	CH_2c-Pr	c-Pr
5-41	Et	1	CH_2c-Pr	c-Pr
5-42	Et	2	CH_2c-Pr	c-Pr
5-43	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
5-44	Et	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
5-45	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
5-46	Et	0	Me	c-Bu
5-47	Et	1	Me	c-Bu
5-48	Et	2	Me	c-Bu
5-49	Et	0	Et	c-Bu
5-50	Et	1	Et	c-Bu
5-51	Et	2	Et	c-Bu
5-52	Et	0	c-Pr	c-Bu
5-53	Et	1	c-Pr	c-Bu
5-54	Et	2	c-Pr	c-Bu
5-55	Et	0	CH_2c-Pr	c-Bu
5-56	Et	1	CH_2c-Pr	c-Bu
5-57	Et	2	CH_2c-Pr	c-Bu
5-58	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
5-59	Et	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
5-60	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
5-61	c-Pr	0	Me	c-Pr
5-62	c-Pr	1	Me	c-Pr
5-63	c-Pr	2	Me	c-Pr
5-64	c-Pr	0	Et	c-Pr
5-65	c-Pr	1	Et	c-Pr

No.	X	n	R	Z
5-66	c-Pr	2	Et	c-Pr
5-67	c-Pr	0	c-Pr	c-Pr
5-68	c-Pr	1	c-Pr	c-Pr
5-69	c-Pr	2	c-Pr	c-Pr
5-70	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Pr
5-71	c-Pr	1	CH_2c-Pr	c-Pr
5-72	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Pr
5-73	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
5-74	c-Pr	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
5-75	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
5-76	c-Pr	0	Me	c-Bu
5-77	c-Pr	1	Me	c-Bu
5-78	c-Pr	2	Me	c-Bu
5-79	c-Pr	0	Et	c-Bu
5-80	c-Pr	1	Et	c-Bu
5-81	c-Pr	2	Et	c-Bu
5-82	c-Pr	0	c-Pr	c-Bu
5-83	c-Pr	1	c-Pr	c-Bu
5-84	c-Pr	2	c-Pr	c-Bu
5-85	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Bu
5-86	c-Pr	1	CH_2c-Pr	c-Bu
5-87	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Bu
5-88	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
5-89	c-Pr	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
5-90	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu

【表６】

表６：一般式（Ｉ）〔式中、QはQ3であり、及び、R^yは塩素原子である〕で表される本発明化合物



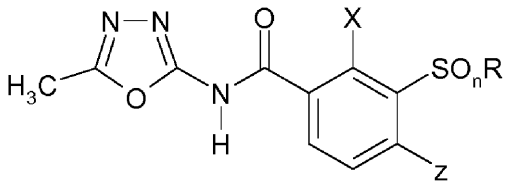
No.	X	n	R	Z
6-1	Me	0	Me	c-Pr
6-2	Me	1	Me	c-Pr
6-3	Me	2	Me	c-Pr
6-4	Me	0	Et	c-Pr
6-5	Me	1	Et	c-Pr
6-6	Me	2	Et	c-Pr
6-7	Me	0	c-Pr	c-Pr
6-8	Me	1	c-Pr	c-Pr
6-9	Me	2	c-Pr	c-Pr
6-10	Me	0	CH_2c-Pr	c-Pr
6-11	Me	1	CH_2c-Pr	c-Pr
6-12	Me	2	CH_2c-Pr	c-Pr
6-13	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
6-14	Me	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
6-15	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
6-16	Me	0	Me	c-Bu
6-17	Me	1	Me	c-Bu
6-18	Me	2	Me	c-Bu
6-19	Me	0	Et	c-Bu
6-20	Me	1	Et	c-Bu
6-21	Me	2	Et	c-Bu
6-22	Me	0	c-Pr	c-Bu
6-23	Me	1	c-Pr	c-Bu
6-24	Me	2	c-Pr	c-Bu
6-25	Me	0	CH_2c-Pr	c-Bu
6-26	Me	1	CH_2c-Pr	c-Bu
6-27	Me	2	CH_2c-Pr	c-Bu
6-28	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
6-29	Me	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu

No.	X	n	R	Z
6-30	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
6-31	Et	0	Me	c-Pr
6-32	Et	1	Me	c-Pr
6-33	Et	2	Me	c-Pr
6-34	Et	0	Et	c-Pr
6-35	Et	1	Et	c-Pr
6-36	Et	2	Et	c-Pr
6-37	Et	0	c-Pr	c-Pr
6-38	Et	1	c-Pr	c-Pr
6-39	Et	2	c-Pr	c-Pr
6-40	Et	0	CH_2c-Pr	c-Pr
6-41	Et	1	CH_2c-Pr	c-Pr
6-42	Et	2	CH_2c-Pr	c-Pr
6-43	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
6-44	Et	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
6-45	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
6-46	Et	0	Me	c-Bu
6-47	Et	1	Me	c-Bu
6-48	Et	2	Me	c-Bu
6-49	Et	0	Et	c-Bu
6-50	Et	1	Et	c-Bu
6-51	Et	2	Et	c-Bu
6-52	Et	0	c-Pr	c-Bu
6-53	Et	1	c-Pr	c-Bu
6-54	Et	2	c-Pr	c-Bu
6-55	Et	0	CH_2c-Pr	c-Bu
6-56	Et	1	CH_2c-Pr	c-Bu
6-57	Et	2	CH_2c-Pr	c-Bu
6-58	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
6-59	Et	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
6-60	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
6-61	c-Pr	0	Me	c-Pr
6-62	c-Pr	1	Me	c-Pr
6-63	c-Pr	2	Me	c-Pr
6-64	c-Pr	0	Et	c-Pr
6-65	c-Pr	1	Et	c-Pr

No.	X	n	R	Z
6-66	c-Pr	2	Et	c-Pr
6-67	c-Pr	0	c-Pr	c-Pr
6-68	c-Pr	1	c-Pr	c-Pr
6-69	c-Pr	2	c-Pr	c-Pr
6-70	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Pr
6-71	c-Pr	1	CH_2c-Pr	c-Pr
6-72	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Pr
6-73	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
6-74	c-Pr	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
6-75	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
6-76	c-Pr	0	Me	c-Bu
6-77	c-Pr	1	Me	c-Bu
6-78	c-Pr	2	Me	c-Bu
6-79	c-Pr	0	Et	c-Bu
6-80	c-Pr	1	Et	c-Bu
6-81	c-Pr	2	Et	c-Bu
6-82	c-Pr	0	c-Pr	c-Bu
6-83	c-Pr	1	c-Pr	c-Bu
6-84	c-Pr	2	c-Pr	c-Bu
6-85	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Bu
6-86	c-Pr	1	CH_2c-Pr	c-Bu
6-87	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Bu
6-88	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
6-89	c-Pr	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
6-90	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu

【表７】

表７：一般式（Ｉ）〔式中、QはQ4であり、及び、R^zはメチル基である〕で表される本発明化合物



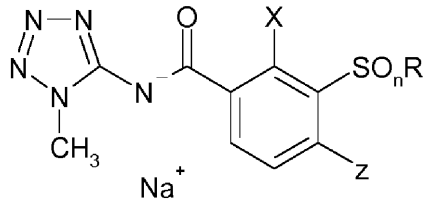
No.	X	n	R	Z
7-1	Me	0	Me	c-Pr
7-2	Me	1	Me	c-Pr
7-3	Me	2	Me	c-Pr
7-4	Me	0	Et	c-Pr
7-5	Me	1	Et	c-Pr
7-6	Me	2	Et	c-Pr
7-7	Me	0	c-Pr	c-Pr
7-8	Me	1	c-Pr	c-Pr
7-9	Me	2	c-Pr	c-Pr
7-10	Me	0	CH_2c-Pr	c-Pr
7-11	Me	1	CH_2c-Pr	c-Pr
7-12	Me	2	CH_2c-Pr	c-Pr
7-13	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
7-14	Me	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
7-15	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
7-16	Me	0	Me	c-Bu
7-17	Me	1	Me	c-Bu
7-18	Me	2	Me	c-Bu
7-19	Me	0	Et	c-Bu
7-20	Me	1	Et	c-Bu
7-21	Me	2	Et	c-Bu
7-22	Me	0	c-Pr	c-Bu
7-23	Me	1	c-Pr	c-Bu
7-24	Me	2	c-Pr	c-Bu
7-25	Me	0	CH_2c-Pr	c-Bu
7-26	Me	1	CH_2c-Pr	c-Bu
7-27	Me	2	CH_2c-Pr	c-Bu
7-28	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu

No.	X	n	R	Z
7-29	Me	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
7-30	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
7-31	Et	0	Me	c-Pr
7-32	Et	1	Me	c-Pr
7-33	Et	2	Me	c-Pr
7-34	Et	0	Et	c-Pr
7-35	Et	1	Et	c-Pr
7-36	Et	2	Et	c-Pr
7-37	Et	0	c-Pr	c-Pr
7-38	Et	1	c-Pr	c-Pr
7-39	Et	2	c-Pr	c-Pr
7-40	Et	0	CH_2c-Pr	c-Pr
7-41	Et	1	CH_2c-Pr	c-Pr
7-42	Et	2	CH_2c-Pr	c-Pr
7-43	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
7-44	Et	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
7-45	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
7-46	Et	0	Me	c-Bu
7-47	Et	1	Me	c-Bu
7-48	Et	2	Me	c-Bu
7-49	Et	0	Et	c-Bu
7-50	Et	1	Et	c-Bu
7-51	Et	2	Et	c-Bu
7-52	Et	0	c-Pr	c-Bu
7-53	Et	1	c-Pr	c-Bu
7-54	Et	2	c-Pr	c-Bu
7-55	Et	0	CH_2c-Pr	c-Bu
7-56	Et	1	CH_2c-Pr	c-Bu
7-57	Et	2	CH_2c-Pr	c-Bu
7-58	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
7-59	Et	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
7-60	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
7-61	c-Pr	0	Me	c-Pr
7-62	c-Pr	1	Me	c-Pr
7-63	c-Pr	2	Me	c-Pr
7-64	c-Pr	0	Et	c-Pr

No.	X	n	R	Z
7-65	c-Pr	1	Et	c-Pr
7-66	c-Pr	2	Et	c-Pr
7-67	c-Pr	0	c-Pr	c-Pr
7-68	c-Pr	1	c-Pr	c-Pr
7-69	c-Pr	2	c-Pr	c-Pr
7-70	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Pr
7-71	c-Pr	1	CH_2c-Pr	c-Pr
7-72	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Pr
7-73	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
7-74	c-Pr	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
7-75	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
7-76	c-Pr	0	Me	c-Bu
7-77	c-Pr	1	Me	c-Bu
7-78	c-Pr	2	Me	c-Bu
7-79	c-Pr	0	Et	c-Bu
7-80	c-Pr	1	Et	c-Bu
7-81	c-Pr	2	Et	c-Bu
7-82	c-Pr	0	c-Pr	c-Bu
7-83	c-Pr	1	c-Pr	c-Bu
7-84	c-Pr	2	c-Pr	c-Bu
7-85	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Bu
7-86	c-Pr	1	CH_2c-Pr	c-Bu
7-87	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Bu
7-88	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
7-89	c-Pr	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
7-90	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu

【表８】

表８：一般式（Ｉ）〔式中、QはQ1であり、及び、R^xはメチル基である〕で表され、ナトリウム塩の形態にある本発明化合物



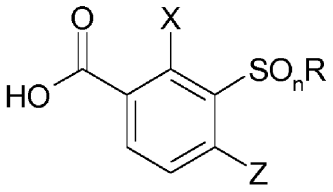
No.	X	n	R	Z
8-1	Me	0	Me	c-Pr
8-2	Me	1	Me	c-Pr
8-3	Me	2	Me	c-Pr
8-4	Me	0	Et	c-Pr
8-5	Me	1	Et	c-Pr
8-6	Me	2	Et	c-Pr
8-7	Me	0	c-Pr	c-Pr
8-8	Me	1	c-Pr	c-Pr
8-9	Me	2	c-Pr	c-Pr
8-10	Me	0	CH_2c-Pr	c-Pr
8-11	Me	1	CH_2c-Pr	c-Pr
8-12	Me	2	CH_2c-Pr	c-Pr
8-13	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
8-14	Me	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
8-15	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
8-16	Me	0	Me	c-Bu
8-17	Me	1	Me	c-Bu
8-18	Me	2	Me	c-Bu
8-19	Me	0	Et	c-Bu
8-20	Me	1	Et	c-Bu
8-21	Me	2	Et	c-Bu
8-22	Me	0	c-Pr	c-Bu
8-23	Me	1	c-Pr	c-Bu
8-24	Me	2	c-Pr	c-Bu
8-25	Me	0	CH_2c-Pr	c-Bu
8-26	Me	1	CH_2c-Pr	c-Bu
8-27	Me	2	CH_2c-Pr	c-Bu
8-28	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu

No.	X	n	R	Z
8-29	Me	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
8-30	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
8-31	Et	0	Me	c-Pr
8-32	Et	1	Me	c-Pr
8-33	Et	2	Me	c-Pr
8-34	Et	0	Et	c-Pr
8-35	Et	1	Et	c-Pr
8-36	Et	2	Et	c-Pr
8-37	Et	0	c-Pr	c-Pr
8-38	Et	1	c-Pr	c-Pr
8-39	Et	2	c-Pr	c-Pr
8-40	Et	0	CH_2c-Pr	c-Pr
8-41	Et	1	CH_2c-Pr	c-Pr
8-42	Et	2	CH_2c-Pr	c-Pr
8-43	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
8-44	Et	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
8-45	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
8-46	Et	0	Me	c-Bu
8-47	Et	1	Me	c-Bu
8-48	Et	2	Me	c-Bu
8-49	Et	0	Et	c-Bu
8-50	Et	1	Et	c-Bu
8-51	Et	2	Et	c-Bu
8-52	Et	0	c-Pr	c-Bu
8-53	Et	1	c-Pr	c-Bu
8-54	Et	2	c-Pr	c-Bu
8-55	Et	0	CH_2c-Pr	c-Bu
8-56	Et	1	CH_2c-Pr	c-Bu
8-57	Et	2	CH_2c-Pr	c-Bu
8-58	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
8-59	Et	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
8-60	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
8-61	c-Pr	0	Me	c-Pr
8-62	c-Pr	1	Me	c-Pr
8-63	c-Pr	2	Me	c-Pr
8-64	c-Pr	0	Et	c-Pr

No.	X	n	R	Z
8-65	c-Pr	1	Et	c-Pr
8-66	c-Pr	2	Et	c-Pr
8-67	c-Pr	0	c-Pr	c-Pr
8-68	c-Pr	1	c-Pr	c-Pr
8-69	c-Pr	2	c-Pr	c-Pr
8-70	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Pr
8-71	c-Pr	1	CH_2c-Pr	c-Pr
8-72	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Pr
8-73	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
8-74	c-Pr	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
8-75	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
8-76	c-Pr	0	Me	c-Bu
8-77	c-Pr	1	Me	c-Bu
8-78	c-Pr	2	Me	c-Bu
8-79	c-Pr	0	Et	c-Bu
8-80	c-Pr	1	Et	c-Bu
8-81	c-Pr	2	Et	c-Bu
8-82	c-Pr	0	c-Pr	c-Bu
8-83	c-Pr	1	c-Pr	c-Bu
8-84	c-Pr	2	c-Pr	c-Bu
8-85	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Bu
8-86	c-Pr	1	CH_2c-Pr	c-Bu
8-87	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Bu
8-88	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
8-89	c-Pr	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
8-90	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu

【表９】

表９：式（ＩＩ）で表される本発明の安息香酸



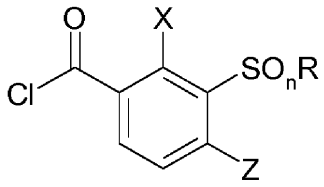
No.	X	n	R	Z
9-1	Me	0	Me	c-Pr
9-2	Me	1	Me	c-Pr
9-3	Me	2	Me	c-Pr
9-4	Me	0	Et	c-Pr
9-5	Me	1	Et	c-Pr
9-6	Me	2	Et	c-Pr
9-7	Me	0	c-Pr	c-Pr
9-8	Me	1	c-Pr	c-Pr
9-9	Me	2	c-Pr	c-Pr
9-10	Me	0	CH_2c-Pr	c-Pr
9-11	Me	1	CH_2c-Pr	c-Pr
9-12	Me	2	CH_2c-Pr	c-Pr
9-13	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
9-14	Me	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
9-15	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
9-16	Me	0	Me	c-Bu
9-17	Me	1	Me	c-Bu
9-18	Me	2	Me	c-Bu
9-19	Me	0	Et	c-Bu
9-20	Me	1	Et	c-Bu
9-21	Me	2	Et	c-Bu
9-22	Me	0	c-Pr	c-Bu
9-23	Me	1	c-Pr	c-Bu
9-24	Me	2	c-Pr	c-Bu
9-25	Me	0	CH_2c-Pr	c-Bu
9-26	Me	1	CH_2c-Pr	c-Bu
9-27	Me	2	CH_2c-Pr	c-Bu
9-28	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
9-29	Me	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
9-30	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu

No.	X	n	R	Z
9-31	Et	0	Me	c-Pr
9-32	Et	1	Me	c-Pr
9-33	Et	2	Me	c-Pr
9-34	Et	0	Et	c-Pr
9-35	Et	1	Et	c-Pr
9-36	Et	2	Et	c-Pr
9-37	Et	0	c-Pr	c-Pr
9-38	Et	1	c-Pr	c-Pr
9-39	Et	2	c-Pr	c-Pr
9-40	Et	0	CH_2c-Pr	c-Pr
9-41	Et	1	CH_2c-Pr	c-Pr
9-42	Et	2	CH_2c-Pr	c-Pr
9-43	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
9-44	Et	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
9-45	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
9-46	Et	0	Me	c-Bu
9-47	Et	1	Me	c-Bu
9-48	Et	2	Me	c-Bu
9-49	Et	0	Et	c-Bu
9-50	Et	1	Et	c-Bu
9-51	Et	2	Et	c-Bu
9-52	Et	0	c-Pr	c-Bu
9-53	Et	1	c-Pr	c-Bu
9-54	Et	2	c-Pr	c-Bu
9-55	Et	0	CH_2c-Pr	c-Bu
9-56	Et	1	CH_2c-Pr	c-Bu
9-57	Et	2	CH_2c-Pr	c-Bu
9-58	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
9-59	Et	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
9-60	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
9-61	c-Pr	0	Me	c-Pr
9-62	c-Pr	1	Me	c-Pr
9-63	c-Pr	2	Me	c-Pr
9-64	c-Pr	0	Et	c-Pr
9-65	c-Pr	1	Et	c-Pr
9-66	c-Pr	2	Et	c-Pr

No.	X	n	R	Z
9-67	c-Pr	0	c-Pr	c-Pr
9-68	c-Pr	1	c-Pr	c-Pr
9-69	c-Pr	2	c-Pr	c-Pr
9-70	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Pr
9-71	c-Pr	1	CH_2c-Pr	c-Pr
9-72	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Pr
9-73	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
9-74	c-Pr	1	CH_2CH_2OMe	c-Pr
9-75	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
9-76	c-Pr	0	Me	c-Bu
9-77	c-Pr	1	Me	c-Bu
9-78	c-Pr	2	Me	c-Bu
9-79	c-Pr	0	Et	c-Bu
9-80	c-Pr	1	Et	c-Bu
9-81	c-Pr	2	Et	c-Bu
9-82	c-Pr	0	c-Pr	c-Bu
9-83	c-Pr	1	c-Pr	c-Bu
9-84	c-Pr	2	c-Pr	c-Bu
9-85	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Bu
9-86	c-Pr	1	CH_2c-Pr	c-Bu
9-87	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Bu
9-88	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
9-89	c-Pr	1	CH_2CH_2OMe	c-Bu
9-90	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu

【表１０】

表１０：　　式（ＩＩＩ）で表される本発明の塩化ベンゾイル



No.	X	n	R	Z
10-1	Me	0	Me	c-Pr
10-2	Me	2	Me	c-Pr
10-3	Me	0	Et	c-Pr
10-4	Me	2	Et	c-Pr
10-5	Me	0	c-Pr	c-Pr
10-6	Me	2	c-Pr	c-Pr
10-7	Me	0	CH_2c-Pr	c-Pr
10-8	Me	2	CH_2c-Pr	c-Pr
10-9	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
10-10	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
10-11	Me	0	Me	c-Bu
10-12	Me	2	Me	c-Bu
10-13	Me	0	Et	c-Bu
10-14	Me	2	Et	c-Bu
10-15	Me	0	c-Pr	c-Bu
10-16	Me	2	c-Pr	c-Bu
10-17	Me	0	CH_2c-Pr	c-Bu
10-18	Me	2	CH_2c-Pr	c-Bu
10-19	Me	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
10-20	Me	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
10-21	Et	0	Me	c-Pr
10-22	Et	2	Me	c-Pr
10-23	Et	0	Et	c-Pr
10-24	Et	2	Et	c-Pr
10-25	Et	0	c-Pr	c-Pr
10-26	Et	2	c-Pr	c-Pr
10-27	Et	0	CH_2c-Pr	c-Pr
10-28	Et	2	CH_2c-Pr	c-Pr
10-29	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
10-30	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr

No.	X	n	R	Z
10-31	Et	0	Me	c-Bu
10-32	Et	2	Me	c-Bu
10-33	Et	0	Et	c-Bu
10-34	Et	2	Et	c-Bu
10-35	Et	0	c-Pr	c-Bu
10-36	Et	2	c-Pr	c-Bu
10-37	Et	0	CH_2c-Pr	c-Bu
10-38	Et	2	CH_2c-Pr	c-Bu
10-39	Et	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
10-40	Et	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu
10-41	c-Pr	0	Me	c-Pr
10-42	c-Pr	2	Me	c-Pr
10-43	c-Pr	0	Et	c-Pr
10-44	c-Pr	2	Et	c-Pr
10-45	c-Pr	0	c-Pr	c-Pr
10-46	c-Pr	2	c-Pr	c-Pr
10-47	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Pr
10-48	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Pr
10-49	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Pr
10-50	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Pr
10-51	c-Pr	0	Me	c-Bu
10-52	c-Pr	2	Me	c-Bu
10-53	c-Pr	0	Et	c-Bu
10-54	c-Pr	2	Et	c-Bu
10-55	c-Pr	0	c-Pr	c-Bu
10-56	c-Pr	2	c-Pr	c-Bu
10-57	c-Pr	0	CH_2c-Pr	c-Bu
10-58	c-Pr	2	CH_2c-Pr	c-Bu
10-59	c-Pr	0	CH_2CH_2OMe	c-Bu
10-60	c-Pr	2	CH_2CH_2OMe	c-Bu

【００８８】

上記表中に記載されている式（Ｉ）及び式（ＩＩ）で表される多くの本発明化合物に関するＮＭＲデータは、ＮＭＲピークリスト法を用いて、以下に開示されている。選択された実施例の^{1}Ｈ　ＮＭＲデータは、^{1}Ｈ　ＮＭＲピークリストの形態で示されている。各シグナルピークに対して、最初にδ値（ｐｐｍ）が記載され、次に、丸括弧内に、シグナル強度が記載されている。種々のシグナルピークに関するδ値－シグナル強度数の対が、セミコロンで互いに区切られて記載されている。従って、１つの例に対するピークリストは、以下の形態をとる：

δ_1（強度$_1$）；δ_2（強度$_2$）；．．．；δ_i（強度$_i$）；．．．；δ_n（強度$_n$）。

【００８９】

先鋭なシグナルの強度は、ＮＭＲスペクトルの印刷された例におけるシグナルの高さ（

ｃｍ）と相関し、シグナル強度の真の比率を示している。幅が広いシグナルの場合、数種類のピーク又は該シグナルの中央及びそれらの相対的強度が、当該スペクトルの中の最も強いシグナルとの比較で示され得る。^{1}Ｈ　ＮＭＲピークのリストは、従来の^{1}Ｈ　ＮＭＲのプリントアウトと類似しており、従って、通常、ＮＭＲの慣習的な解釈で記載される全てのピークを含んでいる。さらに、それらは、従来の^{1}Ｈ　ＮＭＲのプリントアウトのように、溶媒のシグナル、目標化合物の立体異性体（これも、同様に、本発明の対象の一部分を形成する）のシグナル及び／又は不純物のピークのシグナルも示し得る。

【００９０】

溶媒及び／又は水のデルタ範囲内における化合物シグナルを示す場合、１Ｈ　ＮＭＲピークの本発明者らによるリストにおいては、通常の溶媒のピーク、例えば、ＤＭＳＯ－Ｄ$_{6}$中のＤＭＳＯのピーク及び水のピーク（これらは、通常、平均して高い強度を有している）が示されている。

【００９１】

本発明の化合物の立体異性体のピーク及び／又は不純物のピークは、通常、平均して、本発明の化合物（例えば、９０％を超える純度を有する本発明の化合物）のピークよりも低い強度を有している。

【００９２】

そのような立体異性体及び／又は不純物は、特定の調製方法に対して特有であり得る。従って、それらのピークは、「副産物の指紋（ｂｙ－ｐｒｏｄｕｃｔ　ｆｉｎｇｅｒｐｒｉｎｔｓ）」に関して、本発明者らの調製方法の再現性を確認するのに役立ち得る。

【００９３】

目標化合物のピークを既知方法（ＭｅｓｔｒｅＣ、ＡＣＤシミュレーション、さらに、経験的に評価された期待値の使用）で計算する専門家は、必用に応じて、場合により付加的な強度フィルターを使用して、本発明の化合物のピークを分離することができる。この分離は、^{1}Ｈ　ＮＭＲの慣習的な解釈における当該ピークのピッキングに類似しているであろう。

【表１１】

式（Ｉ）で表される化合物：

実施例 1-1: ^{1}H-NMR(400,0 MHz, $CDCl_3$): δ= 7,556(0,8);7,535(0,8);7,519(0,6);7,2694(0,6);7,2685(0,6);7,268(0,8);7,267(1,0);7,266(1,1);7,260(117,2);6,996(0,6);6,809(0,9);6,789(0,9);4,101(11,9);2,840(0,8);2,789(7,6);2,307(16,0);2,267(0,7);1,547(4,4);1,143(1,2);1,139(1,1);1,134(0,6);1,127(0,7);1,122(1,1);1,117(1,2);1,106(0,6);0,786(0,5);0,775(1,2);0,770(1,2);0,762(1,1);0,757(1,3);0,008(1,5);0,000(54,5);-0,009(1,5)
実施例 1-2: ^{1}H-NMR(400,0 MHz, $CDCl_3$): δ= 9,854(0,6);7,605(1,3);7,584(1,3);7,519(1,8);7,260(323,9);6,996(1,7);6,933(1,5);6,912(1,4);4,103(0,6);4,088(14,6);3,022(16,0);2,831(0,7);2,708(8,1);2,307(0,6);2,096(3,3);1,545(16,5);1,254(0,5);1,195(0,6);1,177(1,1);1,156(1,2);0,881(0,6);0,867(0,6);0,858(0,6);0,805(0,7);0,796(0,6);0,008(4,6);0,000(137,8);-0,009(3,9);-0,150(0,5)
実施例 1-3: ^{1}H-NMR(400,0 MHz, $CDCl_3$): δ= 7,704(0,8);7,683(0,9);7,262(29,8);7,093(1,1);7,073(1,0);4,115(8,3);3,264(16,0);3,034(0,8);3,028(0,6);2,823(8,5);1,285(0,7);1,256(3,3);1,215(0,7);1,203(1,6);1,199(1,6);1,194(0,9);1,187(0,9);1,182(1,5);1,178(1,5);1,166(0,6);0,880(0,8);0,874(0,9);0,862(1,9);0,859(2,0);0,849(1,8);0,845(1,8);0,833(0,7);0,000(13,3)
実施例 2-1: ^{1}H-NMR(400,0 MHz, $CDCl_3$): δ= 7,542(0,6);7,519(1,3);7,260(142,8);6,996(0,8);6,800(0,8);6,780(0,8);4,486(1,0);4,468(3,1);4,450(3,1);4,432(1,0);2,850(0,5);2,836(1,1);2,829(0,9);2,823(0,7);2,815(0,6);2,785(9,1);2,310(1,3);2,304(16,0);2,264(1,6);2,044(0,7);1,637(3,3);1,619(6,9);1,600(3,4);1,591(0,6);1,573(1,4);1,555(2,1);1,259(0,6);1,151(0,6);1,140(1,6);1,135(1,7);1,130(0,9);1,124(0,9);1,119(1,7);1,114(1,8);1,103(0,7);0,882(0,6);0,782(0,7);0,770(1,8);0,766(1,9);0,757(1,8);0,753(2,1);0,741(0,7);0,008(1,6);0,000(50,7);-0,009(1,5)
実施例 2-2: ^{1}H-NMR(400,0 MHz, $CDCl_3$): δ= 7,605(1,1);7,585(1,2);7,519(1,2);7,374(0,5);7,260(199,6);7,248(0,6);6,996(1,2);6,921(1,5);6,900(1,4);4,454(0,8);4,437(2,1);4,435(2,2);4,419(2,2);4,417(2,2);4,401(0,8);3,014(16,0);2,782(0,8);2,690(7,5);2,306(1,5);2,090(0,8);1,637(0,6);1,631(3,9);1,618(1,2);1,612(8,6);1,594(4,1);1,551(3,2);1,177(1,4);1,171(0,9);1,161(0,9);1,156(1,4);1,140(0,5);0,878(0,5);0,864(0,6);0,855(0,6);0,794(0,6);0,786(0,6);0,771(0,5);0,008(2,4);0,000(71,6);-0,009(2,1)
実施例 2-3: ^{1}H-NMR(400,0 MHz, $CDCl_3$): δ= 7,687(1,0);7,666(1,0);7,271(0,6);7,270(0,7);7,269(0,8);7,268(0,9);7,261(83,2);7,095(1,2);7,074(1,1);4,501(0,9);4,482(2,8);4,464(2,8);4,446(0,9);3,264(16,0);3,043(0,7);2,834(9,0);2,006(1,2);1,642(3,4);1,624(7,6);1,606(3,5);1,574(1,0);1,219(0,5);1,207(1,3);1,202(1,3);1,198(0,7);1,191(0,7);1,185(1,2);1,181(1,3);1,170(0,6);0,873(0,6);0,862(1,3);0,858(1,4);0,848(1,3);0,844(1,4);0,008(0,9);0,000(27,8);-0,009(0,8)
実施例 3-1: ^{1}H-NMR(400,0 MHz, $CDCl_3$): δ= 7,519(1,3);7,495(0,7);7,2763(0,5);7,2755(0,6);7,275(0,6);7,273(0,7);7,2723(0,8);7,2715(0,9);7,271(1,0);7,270(1,1);7,2683(1,5);7,2675(1,7);7,267(1,9);7,260(158,8);6,996(0,9);6,800(0,9);6,780(0,9);5,300(4,4);4,412(1,4);4,394(1,8);4,375(1,5);2,837(0,7);2,781(7,0);2,314(0,6);2,305(16,0);2,049(0,8);2,031(1,5);2,012(1,5);1,994(0,9);1,551(2,0);1,153(0,5);1,142(1,3);1,137(1,3);1,132(0,7);1,126(0,7);1,121(1,3);1,116(1,3);1,105(0,6);1,003(3,1);0,984(6,6);0,966(3,0);0,780(0,6);0,769(1,3);0,764(1,4);0,755(1,3);0,751(1,5);0,739(0,5);0,008(2,0);0,006(0,8);0,000(60,1);-0,006(0,7);-0,007(0,5);-0,009(1,7)
実施例 3-2: ^{1}H-NMR(400,0 MHz, $CDCl_3$): δ= 7,584(1,0);7,564(1,0);7,519(2,2);7,292(0,6);7,276(1,4);7,273(2,0);7,260(387,6);7,252(1,5);7,250(0,9);7,249(0,9);7,210(0,7);6,996(2,2);6,927(1,5);6,907(1,4);4,384(1,1);4,381(1,2);4,366(2,0);4,361(1,9);4,347(1,2);4,344(1,2);3,247(1,2);3,016(16,0);2,834(0,7);2,702(7,1);2,093(0,9);2,044(1,1);2,025(2,1);2,007(2,1);1,988(1,2);1,548(17,9);1,189(0,5);1,174(1,4);1,168(0,9);1,153(1,3);1,007(4,1);0,995(0,9);0,989(8,7);0,970(3,8);0,860(0,6);0,851(0,6);0,799(0,7);0,791(0,6);0,008(4,3);0,000(134,5);-0,009(3,9)

実施例 3-3: ^{1}H-NMR(400,0 MHz, $CDCl_3$): δ= 7,664(1,0);7,644(1,1);7,519(0,7);7,311(0,8);7,273(1,0);7,272(0,9);7,261(126,8);7,237(1,0);7,211(0,6);7,183(1,0);7,176(0,5);7,167(0,6);7,165(0,7);7,163(0,7);7,162(0,6);7,092(1,2);7,071(1,2);6,997(0,8);4,427(1,5);4,409(1,9);4,391(1,5);3,356(0,6);3,270(0,8);3,261(16,0);3,235(0,5);3,043(0,8);2,836(9,4);2,356(3,7);2,088(1,2);2,050(0,9);2,032(1,6);2,013(1,7);1,995(1,0);1,567(1,1);1,219(0,5);1,207(1,3);1,203(1,4);1,198(0,8);1,191(0,8);1,186(1,3);1,182(1,4);1,170(0,6);1,010(3,5);0,991(7,4);0,973(3,3);0,869(0,6);0,857(1,4);0,854(1,6);0,844(1,4);0,840(1,5);0,828(0,6);0,008(1,4);0,000(45,9);-0,009(1,4)
実施例 4-1: ^{1}H-NMR(400,0 MHz, $CDCl_3$): δ= 7,519(1,2);7,494(1,8);7,456(0,9);7,436(0,9);7,260(214,1);6,996(1,1);6,777(1,0);6,756(1,0);3,880(10,0);2,830(0,7);2,757(8,3);2,297(16,0);2,045(0,6);1,542(13,1);1,146(0,5);1,134(1,2);1,130(1,2);1,125(0,6);1,118(0,7);1,113(1,2);1,108(1,1);1,097(0,5);0,768(0,5);0,757(1,2);0,752(1,2);0,743(1,1);0,739(1,3);0,008(2,8);0,000(95,1);-0,009(2,6)
実施例 4-2: ^{1}H-NMR(400,0 MHz, d_6-DMSO): δ= 10,987(1,4);7,877(2,3);7,562(0,7);7,543(0,8);7,048(1,1);7,028(1,1);3,743(16,0);3,420(0,5);3,390(0,5);3,359(0,7);3,354(0,9);3,350(1,0);3,320(733,1);3,297(31,4);3,270(1,4);3,174(0,7);3,161(0,7);3,018(14,4);2,863(0,5);2,844(0,6);2,675(1,3);2,670(1,8);2,665(1,4);2,661(0,8);2,646(9,4);2,540(1,1);2,523(4,9);2,519(7,6);2,510(96,8);2,506(208,5);2,501(288,8);2,496(201,8);2,492(89,9);2,474(1,2);2,469(1,1);2,460(0,8);2,456(0,8);2,451(0,9);2,447(0,5);2,337(0,5);2,332(1,2);2,328(1,7);2,323(1,3);2,299(0,5);1,094(0,5);1,085(0,6);0,999(0,5);0,926(0,6);0,913(0,7);0,735(0,6);0,720(0,6);0,000(0,5)
実施例 4-3: ^{1}H-NMR(400,0 MHz, $CDCl_3$): δ= 7,604(0,8);7,584(0,9);7,410(1,1);7,261(52,3);7,063(1,1);7,042(1,1);3,890(9,3);3,230(16,0);3,042(0,7);2,815(9,1);2,055(0,9);1,285(0,6);1,255(1,8);1,212(0,6);1,200(1,4);1,196(1,4);1,191(0,8);1,184(0,8);1,179(1,4);1,175(1,4);1,163(0,7);0,849(0,7);0,837(1,5);0,834(1,6);0,824(1,4);0,820(1,5);0,808(0,5);0,008(0,7);0,000(23,5);-0,009(0,7)
実施例 7-1: ^{1}H-NMR(400,0 MHz, $CDCl_3$): δ= 7,261(70,3);6,751(1,2);6,731(1,2);5,300(1,6);2,821(0,9);2,762(11,2);2,543(10,9);2,296(16,0);2,007(7,2);1,561(2,5);1,133(0,6);1,121(1,4);1,117(1,4);1,112(0,8);1,105(0,8);1,100(1,4);1,095(1,4);1,084(0,6);0,759(0,7);0,748(1,6);0,744(1,6);0,735(1,5);0,731(1,6);0,719(0,5);0,008(0,9);0,000(28,7);-0,009(0,7)
実施例 7-2: ^{1}H-NMR(400,0 MHz, $CDCl_3$): δ= 7,532(0,7);7,520(0,7);7,511(0,8);7,261(98,5);7,228(0,7);6,997(0,5);6,871(1,5);6,851(1,4);3,001(16,0);2,655(7,4);2,547(15,5);1,333(0,7);1,285(1,0);1,255(0,7);1,119(0,6);1,110(0,7);1,106(0,6);1,097(0,8);1,087(0,5);1,076(0,5);0,834(0,6);0,768(0,5);0,758(0,6);0,744(0,5);0,008(1,0);0,000(34,6);-0,009(1,0)
実施例 7-3: ^{1}H-NMR(400,0 MHz, d_6-DMSO): δ= 12,049(4,0);7,606(13,5);7,586(15,1);7,145(13,9);7,124(12,9);5,755(10,3);3,352(147,7);3,314(712,8);3,290(37,0);2,894(7,6);2,880(4,2);2,674(6,3);2,670(9,0);2,665(6,6);2,638(96,5);2,539(10,8);2,534(12,5);2,530(10,5);2,523(23,2);2,518(34,1);2,510(496,8);2,505(1075,7);2,501(1494,7);2,496(1040,4);2,491(467,1);2,475(130,1);2,332(5,6);2,328(8,5);2,323(6,0);2,073(13,1);1,335(2,9);1,298(3,0);1,259(4,6);1,250(4,7);1,235(4,9);1,118(4,6);1,107(12,3);1,102(13,3);1,091(7,4);1,086(13,0);1,081(13,4);1,070(5,8);0,864(5,7);0,848(16,0);0,835(14,5);0,824(4,3);0,034(2,6);0,008(15,2);0,000(516,1);-0,009(15,7)

【表１２】

式（ＩＩ）で表される化合物：

実施例 9-1: ^{1}H-NMR (400,0 MHz, d_6-DMSO): δ= 7,628 (1,5); 7,608 (1,6); 6,806 (1,3); 6,785 (1,2); 3,320 (3,2); 2,772 (0,6); 2,749 (9,5); 2,737 (0,9); 2,723 (0,5); 2,511 (4,4); 2,507 (9,5); 2,502 (13,3); 2,498 (9,6); 2,493 (4,7); 2,478 (0,6); 2,258 (16,0); 2,029 (0,7); 1,078 (1,2); 1,072 (1,3); 1,068 (0,7); 1,062 (0,7); 1,057 (1,3); 1,051 (1,3); 1,041 (0,6); 0,752 (0,5); 0,741 (1,3); 0,736 (1,4); 0,728 (1,3); 0,723 (1,4); 0,712 (0,5); 0,000 (5,4)

【００９４】

Ｂ．　製剤実施例

（ａ）　散粉性製品（ｄｕｓｔｉｎｇ　ｐｒｏｄｕｃｔ）は、１０重量部の式（Ｉ）で表される化合物及び／又はその塩と９０重量部の不活性物質としてのタルクを混合させ、並びに、その混合物をハンマーミルの中で粉砕することによって得られる。

【００９５】

（ｂ）　水に容易に分散する水和剤は、２５重量部の式（Ｉ）で表される化合物及び／又はその塩と６４重量部の不活性物質としてのカオリン含有石英と１０重量部のリグノスルホン酸カリウムと１重量部の湿潤剤及び分散剤としてのオレオイルメチルタウリンナトリウム（ｓｏｄｉｕｍ　ｏｌｅｏｙｌｍｅｔｈｙｌｔａｕｒａｔｅ）を混合させ、並びに、その混合物をピンディスクミル（ｐｉｎｎｅｄ－ｄｉｓｋ　ｍｉｌｌ）の中で摩砕することによって得られる。

【００９６】

（ｃ）　水に容易に分散する分散製剤（ｄｉｓｐｅｒｓｉｏｎ　ｃｏｎｃｅｎｔｒａｔｅ）は、２０重量部の式（Ｉ）で表される化合物及び／又はその塩を６重量部のアルキルフェノールポリグリコールエーテル（（登録商標）Ｔｒｉｔｏｎ　Ｘ　２０７）と３重量部のイソトリデカノールポリグリコールエーテル（８ＥＯ）と７１重量部のパラフィン系鉱油（沸点範囲：例えば、約２５５℃～約２７７℃）と混合させ、並びに、その混合物をフリクションボールミルの中で５ミクロン未満の粉末度になるまで摩砕することによって得られる。

【００９７】

（ｄ）　乳剤は、１５重量部の式（Ｉ）で表される化合物及び／又はその塩と７５重量部の溶媒としてのシクロヘキサノンと１０重量部の乳化剤としてのエトキシ化ノニルフェノールから得られる。

【００９８】

（ｅ）　顆粒水和剤は、
７５重量部の式（Ｉ）で表される化合物及び／又はその塩、
１０重量部のリグノスルホン酸カルシウム、
５重量部のラウリル硫酸ナトリウム、
３重量部のポリビニルアルコール、及び、
７重量部のカオリン
を混合させ、その混合物をピンディスクミルの中で摩砕し、並びに、得られた粉末を、流動床の中で造粒液（ｇｒａｎｕｌａｔｉｎｇ　ｌｉｑｕｉｄ）としての水を噴霧施用することにより、造粒することによって得られる。

【００９９】

（ｆ）　顆粒水和剤は、さらにまた、コロイドミルの中で、
２５重量部の式（Ｉ）で表される化合物及び／又はその塩、
５重量部の２，２’－ジナフチルメタン－６，６’－ジスルホン酸ナトリウム、
２重量部のオレオイルメチルタウリンナトリウム（ｓｏｄｉｕｍ　ｏｌｅｏｙｌｍｅｔｈｙｌｔａｕｒａｔｅ）、
１重量部のポリビニルアルコール、
１７重量部の炭酸カルシウム、及び、
５０重量部の水
を均質化及び前粉砕し、次いで、その混合物をビーズミルの中で摩砕し、並びに、得られた懸濁液を噴霧棟の中で単一相ノズル（ｏｎｅ－ｐｈａｓｅ　ｎｏｚｚｌｅ）を用いて噴霧及び乾燥させることによっても得られる。

【０１００】

Ｃ．　生物学的実施例

ここで使用されている略語は、以下のとおりである：

【表１３】

ABUTH	Abutilon theophrasti （イチビ）	ALOMY	Alopecurus myosuroides （ノスズメノテッポウ）
AMARE	Amaranthus retroflexus （アオゲイトウ）	AVEFA	Avena fatua （カラスムギ）
CYPES	Cyperus serotinus （ミズガヤツリ）	ECHCG	Echinochloa crus galli （イヌビエ）
LOLMU	Lolium multiflorum （ネズミムギ）	MATIN	Matricaria inodora （イヌカミツレ）
PHBPU	Pharbitis purpureum （マルバアサガオ）	PHBPU	Pharbitis purpureum （マルバアサガオ）
POLCO	Polygonum convolvulus （ソバカズラ）	STEME	Stellaria media （ハコベ）
VERPE	Veronica persica （オオイヌノフグリ）		

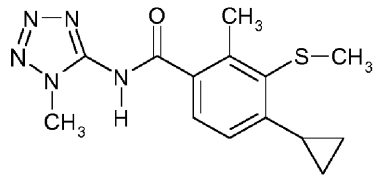
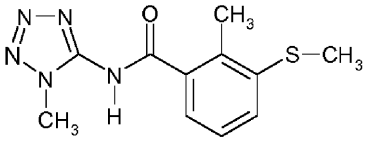
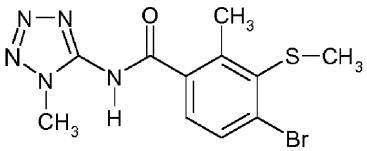
【０１０１】

１．　有害な植物に対する発生前除草作用

木質繊維製ポット内の砂壌土に単子葉及び双子葉の雑草植物及び作物植物の種子を配置し、土壌で被覆する。次いで、その被覆土壌の表面に、水和剤（ＷＰ）の形態に又は乳剤（ＥＣ）として製剤された本発明の化合物及び比較することを目的とした従来技術から知られている化合物を、０．２％の湿潤剤が添加された６００～８００Ｌ／ｈａに相当するの散布水量の水性懸濁液又は水性エマルションとして施用する。処理後、ポットを温室内に置き、その被験植物にとって良好な成育条件下に維持する。３週間の試験期間の後、処理されていない対照と比較することにより、該被験植物に対する損傷を視覚的に評価する（除草活性（％）：１００％の活性＝植物の枯死、０％の活性＝対照植物と同様）。当該実験は、試験された本発明の化合物が、従来技術から知られている構造的に最も近い化合物と比較して、多くの種類の有害な植物に対して高い除草作用を示し、且つ、作物植物においては少ない損傷しかもたらさない、ということを示している。これらの実験から得られたデータは、以下の表に記載されている。

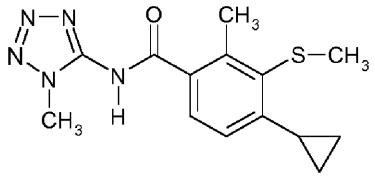
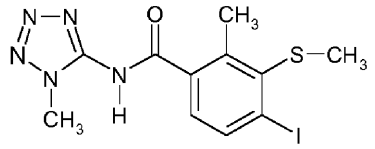
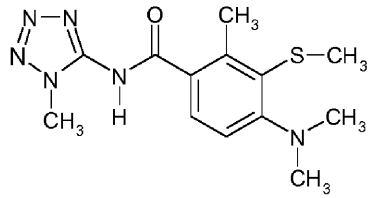
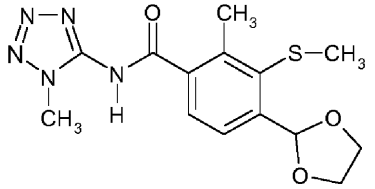
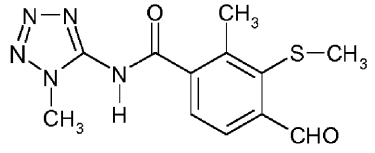
【表１４】

表A

化合物	薬 量 [g/ha]	以下のものに対する活性 CYPES	POLCO
 本発明化合物no. 1-1	320	90%	90%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物no. 4-78	320	30%	0%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物no. 4-122	320	0%	70%

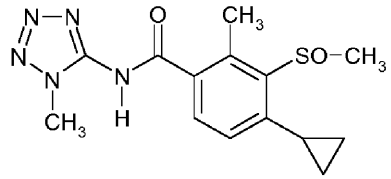
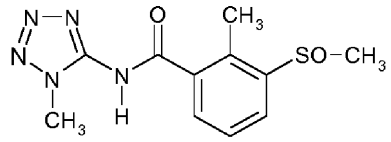
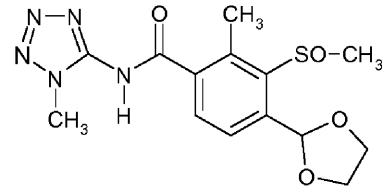
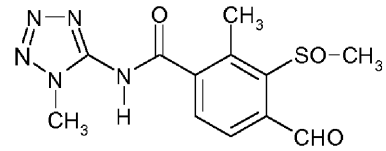
【表１５】

表B

化合物	薬 量 [g/ha]	以下のものに対する活性 CYPES	POLCO
 本発明化合物no. 1-1	320	90%	90%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物no. 4-128	320	0%	20%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物no. 4-429	320	30%	0%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物	320	0%	30%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物	320	0%	0%

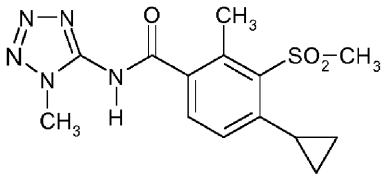
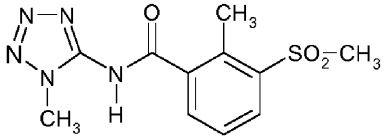
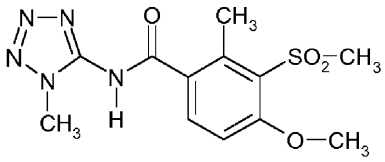
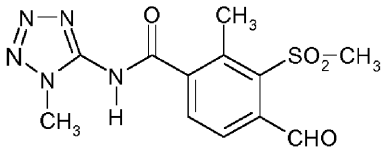
【表１６】

表C

化合物	薬 量 [g/ha]	以下のものに対する活性 ALOMY	AMARE
 本発明化合物no. 1-2	320	90%	100%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物no. 4-79	320	20%	20%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物	320	0%	0%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物	320	0%	0%

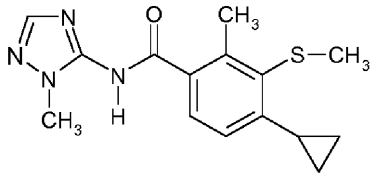
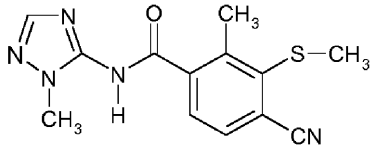
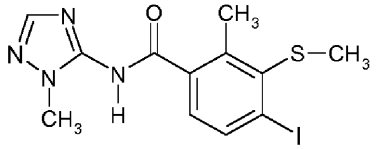
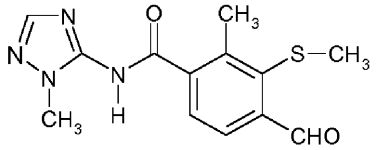
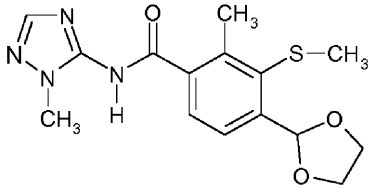
【表１７】

表D

化合物	薬 量 [g/ha]	以下のものに対する活性 ALOMY	POLCO
 本発明化合物no. 1-3	320	100%	90%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物no. 4-79	320	70%	40%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物no. 4-439	320	20%	60%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物	320	0%	60%

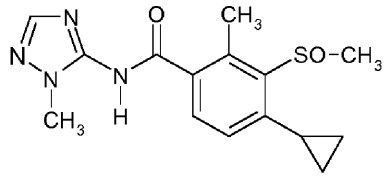
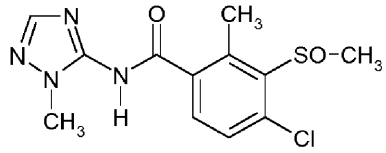
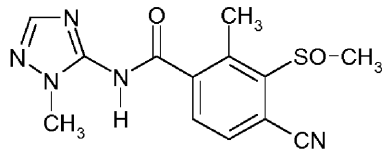
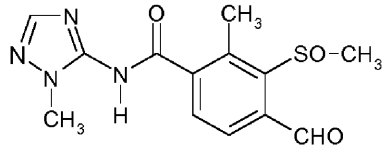
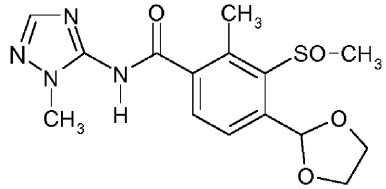
【表１８】

表E

化合物	薬 量 [g/ha]	以下のものに対する活性 AMARE	VERPE
 本発明化合物no. 4-1	320	100%	90%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物no. 1-387	320	80%	70%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物no. 1-139	320	60%	0%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物	320	30%	0%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物	320	0%	0%

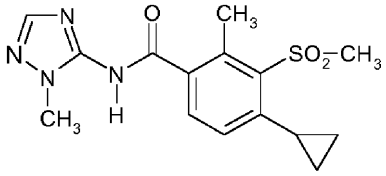
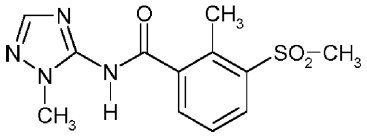
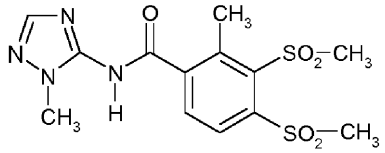
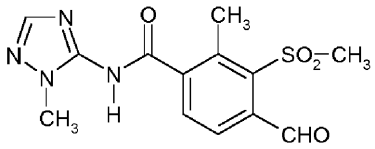
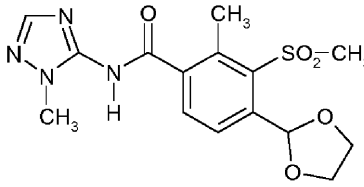
【表１９】

表F

化合物	薬 量 [g/ha]	以下のものに対する活性 AMARE	MATIN
 本発明化合物no. 4-2	320	90%	80%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物no. 1-120	320	70%	30%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物no. 1-388	320	60%	0%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物	320	40%	0%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物	320	20%	0%

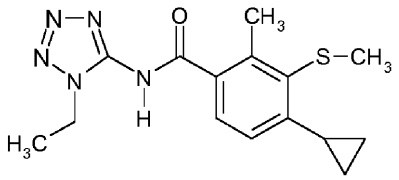
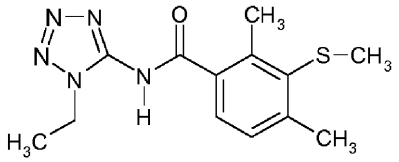
【表２０】

表G

化合物	薬 量 [g/ha]	以下のものに対する活性 ECHCG	AMARE
 本発明化合物no. 4-3	320	90%	100%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物no. 1-90	320	30%	10%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物no. 1-188	320	0%	40%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物	320	20%	0%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物	320	40%	60%

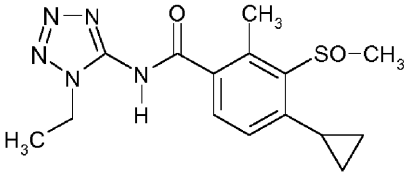
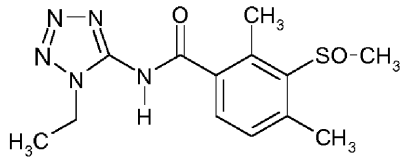
【表２１】

表H

化合物	薬 量 [g/ha]	以下のものに対する活性 AVEFA	LOLMU
 本発明化合物no. 2-1	320	100%	90%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物	320	60%	30%

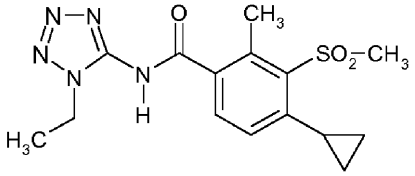
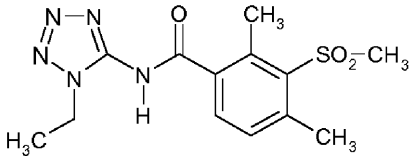
【表２２】

表I

化合物	薬 量 [g/ha]	以下のものに対する活性 LOLMU	PHBPU
 本発明化合物no. 2-2	320	100%	100%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物no. 5-391	320	30%	60%

【表２３】

表J

化合物	薬 量 [g/ha]	以下のものに対する活性 CYPES	ABUTH
 本発明化合物no. 2-3	80	80%	100%
 WO 2012/028579 A1から知られている化合物	80	40%	80%

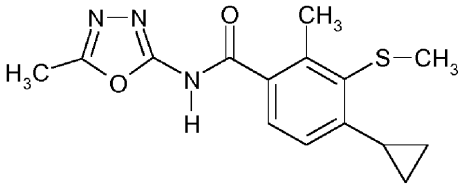
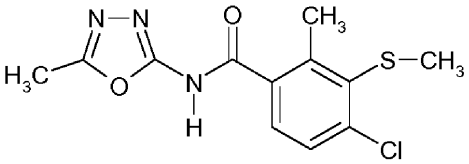
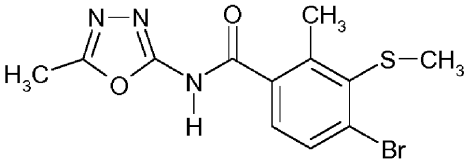
【０１０２】

２．　有害な植物に対する発生後除草作用

木質繊維製ポット内の砂壌土に単子葉及び双子葉の雑草植物及び作物植物の種子を配置し、土壌で被覆し、温室内で良好な成育条件下で栽培する。播種後２～３週間経過した後、被験植物を１葉期で処理する。次いで、当該植物の緑色の部分に、水和剤（ＷＰ）の形態に又は乳剤（ＥＣ）として製剤された本発明の化合物を、０．２％の湿潤剤が添加された６００～８００Ｌ／ｈａに相当する散布水量の水性懸濁液又は水性エマルションの形態で噴霧する。被験植物を温室内で最適な成育条件下に約３週間静置した後、当該調製物の効果について、処理されていない対照と比較して視覚的に評価する（除草効果（％）：１００％の活性＝植物の枯死、０％の活性＝対照植物と同様）。当該実験は、試験された本発明の化合物が、従来技術から知られている構造的に最も近い化合物と比較して、多くの種類の有害な植物に対して高い除草作用を示し、且つ、作物植物においては少ない損傷しかもたらさない、ということを示している。これらの実験から得られたデータは、以下の表に記載されている。

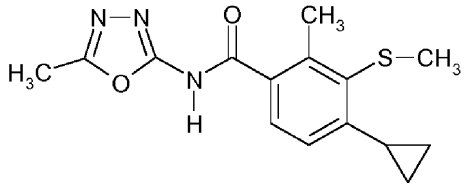
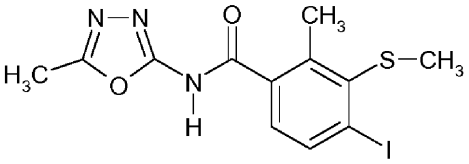
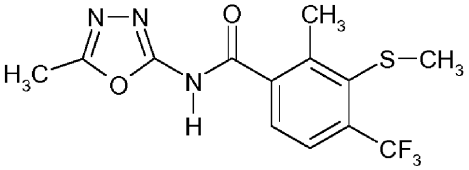
【表２４】

表K

化合物	薬 量 [g/ha]	以下のものに対する活性 MATIN	STEME
 本発明化合物no. 7-1	80	80%	90%
 WO 2012/26932 A1から知られている化合物no. 2-116	80	60%	70%
 WO 2012/26932 A1から知られている化合物no. 2-130	80	40%	60%

【表２５】

表L

化合物	薬 量 [g/ha]	以下のものに対する活性	
		MATIN	POLCO
 本発明化合物no. 7-1	80	80%	60%
 WO 2012/26932 A1から知られている化合物no. 2-136	80	60%	20%
 WO 2012/26932 A1から知られている化合物no. 2-143	80	60%	0%

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2015/064484

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. C07D249/14 C07D257/06 C07D271/04 C07D271/10 C07C317/44
C07C321/28 C07C323/56 A01N43/82 A01N43/653 A01N43/713
ADD.
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)
C07D C07C A01N

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

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2012/028579 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; BRAUN RALF [DE]; KOEHN ARNIM [DE]; VAN ALMS) 8 March 2012 (2012-03-08) cited in the application Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele.	1-10
A	WO 2012/126932 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; KOEHN ARNIM [DE]; AHRENS HARTMUT [DE]; BRAU) 27 September 2012 (2012-09-27) cited in the application Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele.	1-10
A	WO 2011/035874 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; KOEHN ARNIM [DE]; TIEBES JOERG [DE]; VAN AL) 31 March 2011 (2011-03-31) cited in the application Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele.	1-10

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

* Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
17 August 2015	07/09/2015

Name and mailing address of the ISA/	Authorized officer
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Weisbrod, Thomas

1

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2015/064484

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2012028579 A1	08-03-2012	AR 082828 A1	09-01-2013
		AU 2011298424 A1	21-03-2013
		CA 2809487 A1	08-03-2012
		CN 103282354 A	04-09-2013
		CO 6670599 A2	15-05-2013
		DK 2611785 T3	25-08-2014
		EA 201390265 A1	30-08-2013
		EP 2611785 A1	10-07-2013
		ES 2503815 T3	07-10-2014
		HR P20140779 T1	07-11-2014
		JP 2013536817 A	26-09-2013
		KR 20130101506 A	13-09-2013
		PT 2611785 E	09-09-2014
		TW 201221059 A	01-06-2012
		UA 109150 C2	27-07-2015
		US 2012058892 A1	08-03-2012
		UY 33583 A	30-03-2012
		WO 2012028579 A1	08-03-2012
WO 2012126932 A1	27-09-2012	AR 085469 A1	02-10-2013
		AU 2012230388 A1	03-10-2013
		CA 2830773 A1	27-09-2012
		CN 103596946 A	19-02-2014
		EA 201391320 A1	28-02-2014
		EP 2688885 A1	29-01-2014
		JP 2014510088 A	24-04-2014
		KR 20140027953 A	07-03-2014
		US 2014080705 A1	20-03-2014
		WO 2012126932 A1	27-09-2012
WO 2011035874 A1	31-03-2011	AR 078312 A1	26-10-2011
		AU 2010297635 A1	19-04-2012
		CA 2775104 A1	31-03-2011
		CN 102639517 A	15-08-2012
		EP 2480539 A1	01-08-2012
		ES 2428104 T3	05-11-2013
		JP 5728480 B2	03-06-2015
		JP 2013505901 A	21-02-2013
		RU 2012111125 A	27-09-2013
		UA 107672 C2	10-02-2015
		US 2011152084 A1	23-06-2011
		WO 2011035874 A1	31-03-2011

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2015/064484

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
INV. C07D249/14 C07D257/06 C07D271/04 C07D271/10 C07C317/44
C07C321/28 C07C323/56 A01N43/82 A01N43/653 A01N43/713
ADD.
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
C07D C07C A01N

Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)
EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 2012/028579 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; BRAUN RALF [DE]; KOEHN ARNIM [DE]; VAN ALMS) 8. März 2012 (2012-03-08) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele. -----	1-10
A	WO 2012/126932 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; KOEHN ARNIM [DE]; AHRENS HARTMUT [DE]; BRAU) 27. September 2012 (2012-09-27) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele. -----	1-10
A	WO 2011/035874 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; KOEHN ARNIM [DE]; TIEBES JOERG [DE]; VAN AL) 31. März 2011 (2011-03-31) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele. -----	1-10

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen ☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
"E" frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist
"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
17. August 2015	07/09/2015

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde	Bevollmächtigter Bediensteter
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Weisbrod, Thomas

1

Formblatt PCT/ISA/210 (Blatt 2) (April 2005)

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2015/064484

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2012028579 A1	08-03-2012	AR 082828 A1	09-01-2013
		AU 2011298424 A1	21-03-2013
		CA 2809487 A1	08-03-2012
		CN 103282354 A	04-09-2013
		CO 6670599 A2	15-05-2013
		DK 2611785 T3	25-08-2014
		EA 201390265 A1	30-08-2013
		EP 2611785 A1	10-07-2013
		ES 2503815 T3	07-10-2014
		HR P20140779 T1	07-11-2014
		JP 2013536817 A	26-09-2013
		KR 20130101506 A	13-09-2013
		PT 2611785 E	09-09-2014
		TW 201221059 A	01-06-2012
		UA 109150 C2	27-07-2015
		US 2012058892 A1	08-03-2012
		UY 33583 A	30-03-2012
		WO 2012028579 A1	08-03-2012
WO 2012126932 A1	27-09-2012	AR 085469 A1	02-10-2013
		AU 2012230388 A1	03-10-2013
		CA 2830773 A1	27-09-2012
		CN 103596946 A	19-02-2014
		EA 201391320 A1	28-02-2014
		EP 2688885 A1	29-01-2014
		JP 2014510088 A	24-04-2014
		KR 20140027953 A	07-03-2014
		US 2014080705 A1	20-03-2014
		WO 2012126932 A1	27-09-2012
WO 2011035874 A1	31-03-2011	AR 078312 A1	26-10-2011
		AU 2010297635 A1	19-04-2012
		CA 2775104 A1	31-03-2011
		CN 102639517 A	15-08-2012
		EP 2480539 A1	01-08-2012
		ES 2428104 T3	05-11-2013
		JP 5728480 B2	03-06-2015
		JP 2013505901 A	21-02-2013
		RU 2012111125 A	27-09-2013
		UA 107672 C2	10-02-2015
		US 2011152084 A1	23-06-2011
		WO 2011035874 A1	31-03-2011

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		FI			テーマコード（参考）
A01N 43/832	*(2006.01)*	A01N	43/82	103	
A01N 43/824	*(2006.01)*	A01N	43/82	101C	
A01P 13/00	*(2006.01)*	A01P	13/00		
C07D 257/06	*(2006.01)*	C07D	257/06	A	
C07D 271/10	*(2006.01)*	C07D	271/10		
C07D 271/08	*(2006.01)*	C07D	271/08		
A01M 21/04	*(2006.01)*	A01M	21/04	C	

(81)指定国 AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(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),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,NE,SN,TD,TG),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,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

(74)代理人 100137213
弁理士 安藤 健司
(74)代理人 100143823
弁理士 市川 英彦
(74)代理人 100151448
弁理士 青木 孝博
(74)代理人 100183519
弁理士 櫻田 芳恵
(74)代理人 100196483
弁理士 川嵜 洋祐
(74)代理人 100203035
弁理士 五味渕 琢也
(74)代理人 100185959
弁理士 今藤 敏和
(74)代理人 100160749
弁理士 飯野 陽一
(74)代理人 100160255
弁理士 市川 祐輔
(74)代理人 100202267
弁理士 森山 正浩
(74)代理人 100146318
弁理士 岩瀬 吉和
(74)代理人 100127812
弁理士 城山 康文
(72)発明者 アーレンス，ハルトムート
ドイツ国、６３３２９・エーゲルスバハ、アウフ・デア・ヘーエ・１４
(72)発明者 ティーベ，ヨルグ
ドイツ国、６０４３１・フランクフルト、アム・シュバルベンシュヴァンツ・２５
(72)発明者 ヴアルドラフ，クリステイアン
ドイツ国、６１１１８・バート・フイルベル、フランツーレハールーヴエーク・７
(72)発明者 デイートリヒ，ハンスユルグ

ドイツ国、６５８３５・リーダーバッハ・アム・タウヌス、ボニファツイウスシユトラーセ・１ベー
(72)発明者 ガツツヴアイラー，エルマー
ドイツ国、６１２３１・バート・ナウハイム、アム・ナウハイマー・バツハ・２２
(72)発明者 ロージンガー，クリストフアー・ヒュー
ドイツ国、６５７１９・ホーフハイム・アム・タヌウス、アム・ホーホフエルト・３３
(72)発明者 シユムツツラー，デイルク
ドイツ国、６５７９５・ハツタースハイム、ハウプトマンヴエーク・２

Ｆターム(参考) 2B121 AA19 CC05 EA25
4C056 AA01 AB03 AC06 AC07 AD01 AE03 FA03 FB03 FB11 FC01
4H006 AA01 AB84 TA05 TB37 TB61 TC02
4H011 AB01 BB09 DA02 DA15 DA16