(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2019-509251
(P2019-509251A)
(43)公表日　平成31年4月4日(2019.4.4)

(51)Int.Cl.		F I			テーマコード（参考）
C07D 231/20	***(2006.01)***	C07D	231/20	CSPE	4C063
C07D 405/14	***(2006.01)***	C07D	405/14		4H011
A01P 13/00	***(2006.01)***	A01P	13/00		
A01N 43/56	***(2006.01)***	A01N	43/56	C	

審査請求 有　予備審査請求 未請求　（全 135 頁）

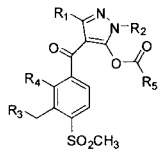
(21)出願番号　特願2018-517441 (P2018-517441)
(86)(22)出願日　平成28年3月4日(2016.3.4)
(85)翻訳文提出日　平成30年4月19日(2018.4.19)
(86)国際出願番号　PCT/CN2016/075578
(87)国際公開番号　WO2017/113509
(87)国際公開日　平成29年7月6日(2017.7.6)
(31)優先権主張番号　201511030154.6
(32)優先日　平成27年12月31日(2015.12.31)
(33)優先権主張国　中国(CN)

(71)出願人　518112435
チンタオ、キングアグルート、ケミカル、コンパウンズ、カンパニー、リミテッド
ＱＩＮＧＤＡＯ　ＫＩＮＧＡＧＲＯＯＴ　ＣＨＥＭＩＣＡＬ　ＣＯＭＰＯＵＮＤＳ　ＣＯ．，ＬＴＤ
中華人民共和国シャントン、チンタオ、シナン、ディストリクト、ナンジン、ロード、ナンバー１００、ビルディング１、ルーム１４０３
(74)代理人　100091982
弁理士　永井　浩之
(74)代理人　100091487
弁理士　中村　行孝

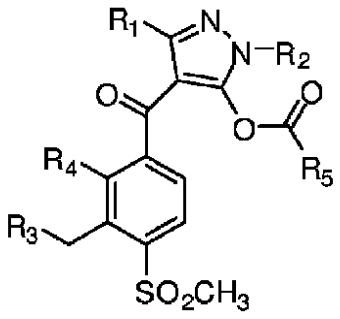
最終頁に続く

(54)【発明の名称】ピラゾール化合物またはその塩、それらの製造方法、除草組成物およびその使用

(57)【要約】
本発明は殺虫剤の技術分野、特にピラゾール化合物またはその塩、その製造方法、除草組成物およびその使用に関する。式Ｉのピラゾール化合物は以下の通りであって、



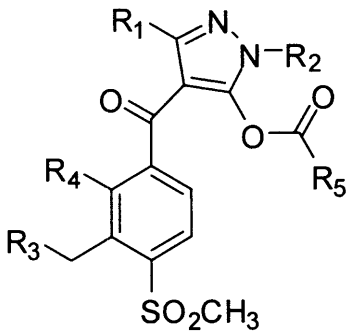
(I)



(Ｉ)

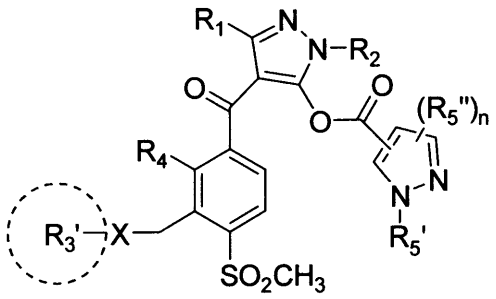
式中、R_1は、水素またはＣ１～Ｃ４アルキルを表し；R_2は、Ｃ１～Ｃ３アルキルを表し；R_3は、Ｏ、ＳおよびＮから選択された１つ以上のヘテロ原子を含有しているＣ１～Ｃ６直鎖または環式基を表し；R_4は、Ｃ１～Ｃ３アルキルまたはハロゲンを表し；R_5は、ピラゾール環またはアルキル、アルコキシル、ハロゲン、ハロゲン化アルキル、アミノおよびニトロから選択された１つ以上の基で置換されたピラゾール環を表す。ピラゾー

【特許請求の範囲】
【請求項１】
下記式（Ｉ）のピラゾール化合物またはその塩：
【化１】



(I)

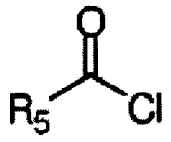
［式中、
Ｒ$_1$は、水素またはＣ１～Ｃ４アルキルを表し；
Ｒ$_2$は、Ｃ１～Ｃ３アルキルを表し；
Ｒ$_3$は、Ｏ、ＳおよびＮから選択された１つ以上のヘテロ原子を含有するＣ１～Ｃ６の直鎖または環式基を表し；
Ｒ$_4$は、Ｃ１～Ｃ３アルキルまたはハロゲンを表し；
Ｒ$_5$は、ピラゾール環、またはアルキル、アルコキシル、ハロゲン、ハロゲン化アルキル、アミノおよびニトロから選択された１つ以上の基で置換されたピラゾール環を表す］。
【請求項２】
前記化合物が、下記式（Ｉ’）の構造を有する、請求項１に記載のピラゾール化合物またはその塩：
【化２】



(I')

［式中、
Ｒ$_1$は、水素またはＣ１～Ｃ４アルキルを表し；
Ｒ$_2$は、Ｃ１～Ｃ３アルキルを表し；
Ｘは、Ｏ、ＮまたはＳを表し、かつＸおよびＲ$_3$’は、環または直鎖を形成していてもよく、ここで、ＸがＯまたはＳである場合、Ｒ$_3$’は、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ３～Ｃ６アルコキシルアルキル、Ｃ２～Ｃ６ハロゲン化アルキル、Ｃ３～Ｃ６アルケニルまたはＣ３～Ｃ６アルキニルを表し；ＸがＮである場合、ＸおよびＲ$_3$’は、ピラゾール環または置換されたピラゾール環、Ｃ３～Ｃ５ラクタム環または置換されたラクタム環を形成し、
Ｒ$_4$は、Ｃ１～Ｃ３アルキルまたはハロゲンを表し；

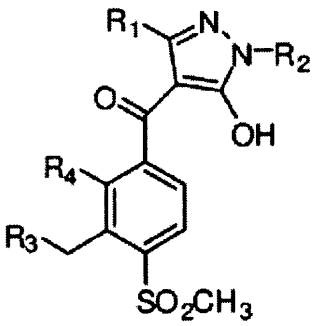
R_5’は、Ｃ１～Ｃ３アルキルを表し；
R_5’’は、水素、Ｃ１～Ｃ３アルキル、Ｃ１～Ｃ３アルコキシル、Ｃ１～Ｃ３ハロゲン化アルキル、ハロゲン、アミノまたはニトロを表し；ｎは、０、１または２であり、ここで、ｎが２である場合、二つのR_5’’は、同一であっても異なっていてもよい］。
【請求項３】
R_1が、水素、メチル、エチルまたはシクロプロピルを表し；
R_2が、メチル、エチルまたはイソプロピルを表し；
Ｘが、Ｏ、ＮまたはＳを表し、ＸおよびR_3’が、環または直鎖を形成していてもよく、ここで、ＸがＯまたはＳである場合、R_3’が、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ３～Ｃ６アルコキシルアルキル、Ｃ２～Ｃ４ハロゲン化アルキル、Ｃ３～Ｃ５アルケニルまたはＣ３～Ｃ５アルキニルを表し；ＸがＮである場合、ＸおよびR_3’が、ピラゾール環または置換されたピラゾール環、Ｃ３～Ｃ５ラクタム環または置換されたラクタム環を形成し、
R_4が、メチルまたは塩素を表し；
R_5’が、メチル、エチルまたはイソプロピルを表し；
R_5’’が、水素、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシル、エトキシル、ジフルオロメチル、クロロまたはブロモを表し；ｎが０、１または２であり、ここで、ｎが２である場合、二つのR_5’’は、同一であっても異なっていてもよい、請求項２に記載のピラゾール化合物またはその塩。
【請求項４】
Ｘが、ＯまたはＮを表し、ＸおよびR_3’が、環または直鎖を形成していてもよく、ここで、ＸがＯである場合、R_3’が、メチル、エチル、ｎ－ブチル、メトキシルエチル、エトキシルエチル、メトキシルイソプロピル、メトキシルｎ－プロピル、２，２－ジフルオロエチル、２，２，２－トリフルオロエチル、１，１，２，２－テトラフルオロプロピル、プロパルギル、２－ブテニルまたはテトラヒドロフルフリルを表し；ＸがＮである場合、ＸおよびR_3’が、ピラゾール環、３－メチルピラゾール環、４－メチルピラゾール環、３，５－ジメチルピラゾール環、４－クロロピラゾール環またはピロリドン環を形成する、請求項３に記載のピラゾール化合物またはその塩。
【請求項５】
式（ＩＩ）の化合物および式（ＩＩＩ）の化合物をエステル化反応に供してピラゾール化合物またはその塩を得る、請求項１に記載のピラゾール化合物またはその塩を製造する方法であって、
該式（ＩＩ）の化合物が以下の通りに示され：
【化３】



II

該式（ＩＩＩ）の化合物が以下の通りに示される、方法：

【化４】



(III)

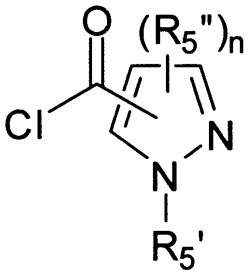
。

【請求項６】

式（ＩＩ’）の化合物および式（ＩＩＩ’）の化合物をエステル化反応に供してピラゾール化合物またはその塩を得る、請求項２～４のいずれか一項に記載のピラゾール化合物またはその塩の製造方法であって、

該式（ＩＩ’）の化合物が以下の通りに示され：

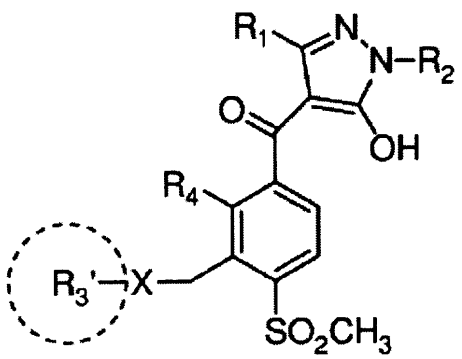
【化５】



(II')

該式（ＩＩＩ’）の化合物が以下の通りに示される、方法：

【化６】

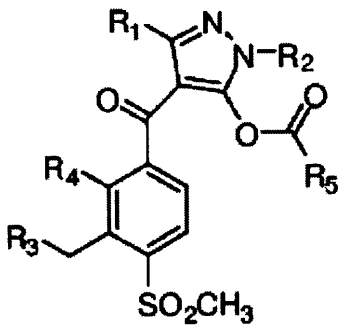


(III')

。

【請求項７】
前記反応が、０．１～１２時間、好ましくは０．５～３時間、温度－１０～５０℃、好ましくは０～２０℃で溶媒およびアルカリの存在下で行われ、該溶媒が、アセトニトリルまたはジクロロメタンであって、該アルカリがトリエチルアミンまたは炭酸カリウムである、請求項５または６に記載の方法。
【請求項８】
除草上有効量の、請求項１～４のいずれか一項に記載の少なくとも１つのピラゾール化合物またはその塩を含んでなる、除草組成物。
【請求項９】
さらに調製補助剤を含んでなる、請求項８に記載の除草組成物。
【請求項１０】
除草上有効量の、請求項１～４のいずれか一項に記載の少なくとも１つのピラゾール化合物もしくはその塩または請求項８もしくは９に記載の除草組成物を、植物または植物が存在する領域に適用する工程を含んでなる、有害植物を防除する方法。
【請求項１１】
有害植物の防除における、請求項１～４のいずれか一項に記載の少なくとも１つのピラゾール化合物もしくはその塩または請求項８もしくは９に記載の除草組成物の使用。
【請求項１２】
前記ピラゾール化合物またはその塩が、所望の作物中の有害植物の防除に使用される、請求項１１に記載の使用。
【請求項１３】
前記所望の作物が、遺伝子組換え作物またはゲノム編集技術により処理された作物である、請求項１２に記載の使用。
【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
本発明は殺虫剤の技術分野、特にピラゾール化合物またはその塩、その製造方法、除草組成物およびその使用に関する。
【背景技術】
【０００２】
雑草防除は、高効率の農業を達成する過程で最も重要な関連性を有する事項である。市場では種々の除草剤が入手可能であるものの、科学者らは依然として継続した研究を行い、高い効能、高い安全性、高い経済性を有し、かつ成長市場、雑草耐性、殺虫剤の耐用年数および経済性、同様に人々の環境に対する懸念への高まりなどの問題による異なる作用様式を有する新しい除草剤を開発することが必要がある。ピラゾール化合物には多くの研究がなされ、例えば、ＣＮ８８１０１４５５Ａは、一般構造中にピラゾール環を含有している一連のピラゾール化合物を示すが、化合物には安全性および活性に多少の欠点がある。
【発明の概要】
【０００３】
分子設計および最適化を通じて、より高い効能、より広域な活性範囲および改善した安全性を有する除草化合物を設計および合成することを目的として、本発明では、除草性有効成分として使用することができるピラゾール環を少なくとも２つ含有している新規のピラゾール化合物を合成した。化合物には、作物に対して、より顕著な活性および改善した安全性がある。
【０００４】
上記の目的を達成するために、本発明は以下の技術的な解決を提供する。
【０００５】
下記式（Ｉ）のピラゾール化合物またはその塩：

【化１】



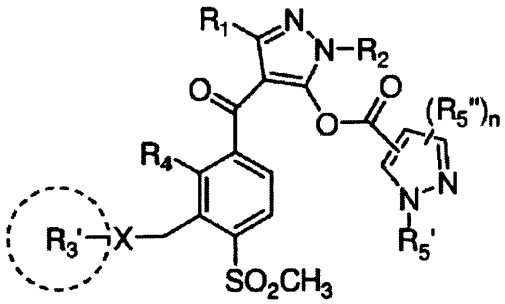
(I)

［式中、
R_1は、水素またはC_1～C_4アルキルを表し；
R_2は、C_1～C_3アルキルを表し；
R_3は、Ｏ、ＳおよびＮから選択された１つ以上のヘテロ原子を含有するC_1～C_6の直鎖または環式基を表し；
R_4は、C_1～C_3アルキルまたはハロゲンを表し；
R_5は、ピラゾール環またはアルキル、アルコキシル、ハロゲン、ハロゲン化アルキル、アミノおよびニトロから選択された１つ以上の基で置換されたピラゾール環を表す］。

【０００６】

好ましくは、ピラゾール化合物またはその塩の構造は以下に示される：

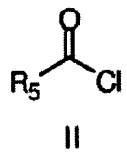
【化２】



(I')

［式中、
R_1は、水素またはC_1～C_4アルキルを表し；
R_2は、C_1～C_3アルキルを表し；
Ｘは、Ｏ、ＮまたはＳを表し、かつＸおよびR_3'は、環または直鎖を形成していてもよく、ここで、ＸがＯまたはＳである場合、R_3'は、C_1～C_6アルキル、C_3～C_6アルコキシルアルキル、C_2～C_6ハロゲン化アルキル、C_3～C_6アルケニルまたはC_3～C_6　アルキニルを表し；ＸがＮである場合、ＸおよびR_3'は、ピラゾール環または置換されたピラゾール環、C_3～C_5ラクタム環または置換されたラクタム環を形成し、
R_4は、C_1～C_3アルキルまたはハロゲンを表し；
R_5'は、C_1～C_3アルキルを表し；
R_5''は、水素、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシル、C_1～C_3ハロゲン化アルキル、ハロゲン、アミノまたはニトロ；ｎは、０、１または２であり、ここで、ｎ

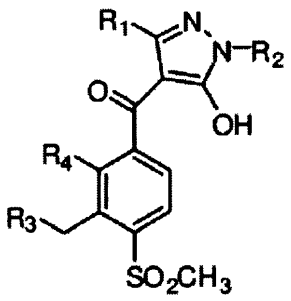
が２である場合、二つのＲ$_5$’’は、同一であっても異なっていてもよい］。
【０００７】
より好ましくは、Ｒ$_1$は、水素、メチル、エチルまたはシクロプロピルを表し；
Ｒ$_2$は、メチル、エチルまたはイソプロピルを表し；
Ｘは、Ｏ、ＮまたはＳを表し、ＸおよびＲ$_3$’は、環または直鎖を形成していてもよく、ここで、ＸがＯまたはＳである場合、Ｒ$_3$’は、Ｃ１～Ｃ６アルキル、Ｃ３～Ｃ６アルコキシルアルキル、Ｃ２～Ｃ４ハロゲン化アルキル、Ｃ３～Ｃ５アルケニルまたはＣ３～Ｃ５アルキニルを表し；ＸがＮである場合、ＸおよびＲ$_3$’は、ピラゾール環または置換されたピラゾール環、Ｃ３～Ｃ５ラクタム環または置換されたラクタム環を形成し、
Ｒ$_4$は、メチルまたは塩素を表し；
Ｒ$_5$’は、メチル、エチルまたはイソプロピルを表し；
Ｒ$_5$’’は、水素、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシル、エトキシル、ジフルオロメチル、クロロまたはブロモを表し、ｎは０、１または２であり、ここで、ｎが２である場合、二つのＲ$_5$’’は、同一であっても異なっていてもよい。
【０００８】
最も好ましくは、Ｘは、ＯまたはＮを表し、ＸおよびＲ$_3$’は、環または直鎖を形成していてもよく、ここでＸがＯである場合、Ｒ$_3$’は、メチル、エチル、ｎ－ブチル、メトキシルエチル、エトキシルエチル、メトキシルイソプロピル、メトキシルｎ－プロピル、２，２－ジフルオロエチル、２，２，２－トリフルオロエチル、１，１，２，２－テトラフルオロプロピル、プロパルギル、２－アルケンブチルまたはテトラヒドロフルフリルを表し；ＸがＮである場合、ＸおよびＲ$_3$’は、ピラゾール環、３－メチルピラゾール環、４－メチルピラゾール環、３，５－ジメチルピラゾール環、４－クロロピラゾール環またはピロリドン環を形成する。
【０００９】
上記した式（Ｉ）の化合物の定義について、使用した用語は、単独または他の用語と組み合わせて以下の置換基を表す：
ハロゲン：フッ素、塩素、臭素およびヨウ素を表す；
アルキル：直鎖状アルキルまたは分岐状アルキルを表す；
ハロゲン化アルキル：水素の全てまたは部分がハロゲン原子と置換されている直鎖状か分岐状アルキルを表す；
アルコキシル：アルキルを酸素原子と結合させることによって形成された官能基を表す。
【００１０】
式（Ｉ）のピラゾール化合物またはその塩を製造する方法であって、式（ＩＩ）の化合物および式（ＩＩＩ）の化合物をエステル化反応に供して式（Ｉ）のピラゾール化合物またはその塩を得る工程を含んでなる方法であって、
ここで式（ＩＩ）の化合物は以下の通りに示され：
【化３】



II

式（ＩＩＩ）の化合物は以下の通りに示され：

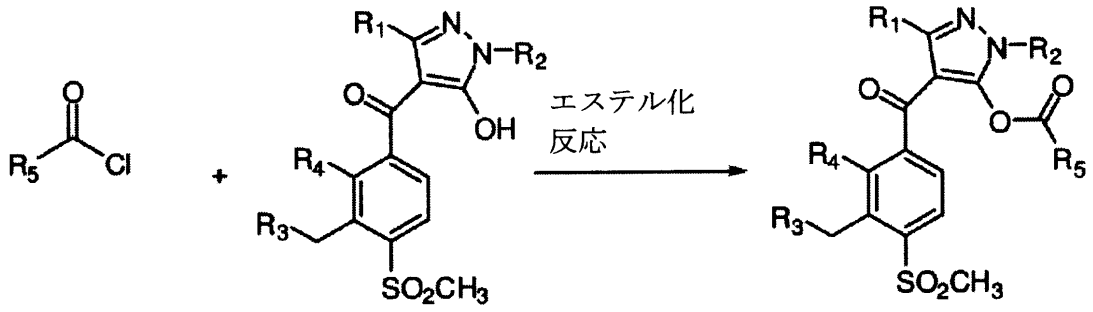
【化４】



(III)

かつ、詳細な反応経路は以下の通りに示される：

【化５】



(II) (III) (I)

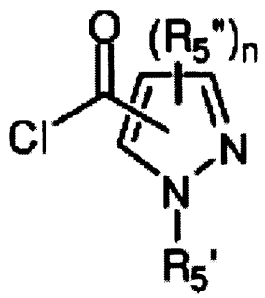
。

【００１１】

式（Ｉ’）のピラゾール化合物またはその塩を製造する方法であって、式（ＩＩ’）の化合物および式（ＩＩＩ’）の化合物をエステル化反応に供して式（Ｉ’）のピラゾール化合物またはその塩を得る工程を含んでなる方法であって、

ここで式（ＩＩ’）の化合物は以下の通りに示され：

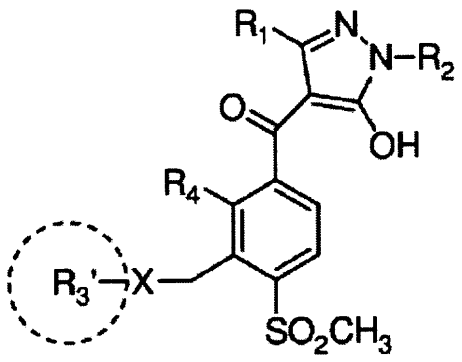
【化６】



(II')

式（ＩＩＩ’）の化合物は以下の通りに示され：

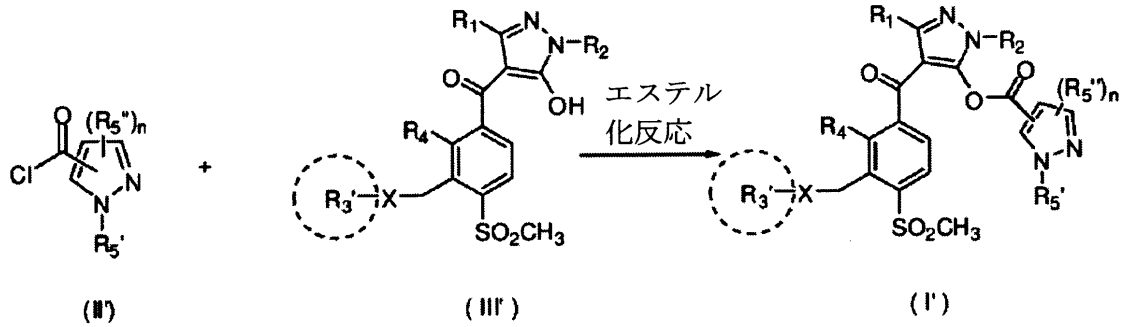
【化７】



(III')

かつ、詳細な反応経路は以下の通りに示される：

【化８】

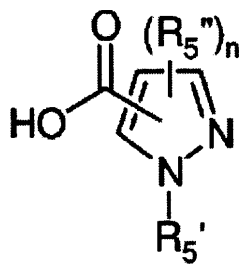


(II') (III') (I')

【００１２】

式（ＩＩ’）の化合物は、対応するカルボン酸（すなわち、式（ＩＩ－１）の化合物）をスルホキシドクロリドと反応させることにより調製することができる。式（ＩＩ－１）の化合物は以下のように示される。

【化９】



(II-1)

【００１３】

式（ＩＩ－１）で示される構造は、ピラゾールカルボン酸の構造である。式は、そのようなピラゾールカルボン酸が、３－ピラゾールカルボン酸または置換された３－ピラゾールカルボン酸、４－ピラゾールカルボン酸または置換された４－ピラゾールカルボン酸あるいは５－ピラゾールカルボン酸または置換された５－ピラゾールカルボン酸であってもよいことを示すものである。

【００１４】

上記した反応経路のエステル化反応は溶媒の存在下で行う必要がある。使用する溶媒は反応に不活性である必要がある。そのような溶媒は、一般に、極性または非極性である非プロトン性溶媒、例えば、アセトニトリル、メチルベンゼン、ジメチルベンゼン、ジクロロメタン、ジクロロエタン、テトラヒドロフラン、アセトン等であり、好ましくはアセトニトリルまたはジクロロメタンである。

【００１５】

上記した反応経路のエステル化反応は脱酸剤の存在下で行う必要があり、使用するこの脱酸剤は通常無機または有機のアルカリである。このような１つ以上のアルカリは、炭酸塩類（例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム）、重炭酸塩類（例えば、重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウム）、アミン類（例えば、ジメチルアミン、トリエチルアミン、Ｎ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン）およびピリジン類（例えば、ピリジン、４－ジメチルアミノピリジン）から選択して使用することができ、トリエチルアミンまたは炭酸カリウムが好ましい。

【００１６】

上記した反応経路のエステル化反応の反応温度は一般に－１０～５０℃の間、好ましくは０～２０℃の間であり、反応時間は０．１～１２時間の間、好ましくは０．５～３時間である。

【００１７】

本発明の化合物は、1つまたは複数の立体異性体の形態で存在してもよい。立体異性体には鏡像体、ジアステレオ異性体および幾何異性体が含まれる。これらの立体異性体およびその混合物の全ては本発明の範囲内である。

【００１８】

また、除草上有効量の少なくとも1つのピラゾール化合物またはその塩を含んでなる除草組成物も開示される。

【００１９】

また、除草組成物は調製補助剤を含んでなる。

【００２０】

また、除草上有効量の少なくとも1つのピラゾール化合物またはその塩または除草組成物を植物または有害植物が存在する領域に適用する工程を含んでなる、有害植物を防除する方法も開示される。

【００２１】

有害植物の防除での、少なくとも1つのピラゾール化合物またはその塩または除草組成物の使用は、好ましくは、ピラゾール化合物またはその塩を、所望の作物の中の有害植物を防除するために適用し、好ましくは、この所望の作物は遺伝子組換え作物またはゲノム編集技術によって処理された作物である。

【００２２】

本発明による式(I)の化合物は、広範囲の経済的に重要な単子葉および双子葉の有害植物に対して顕著な除草活性を有する。また活性化合物は、地下茎、根茎または他の多年生器官から芽を出し、かつ防除が困難である多年生雑草に効果的に作用する。本文脈では、物質が播種前、出芽前または出芽後に適用されたか否かは、概して重要ではない。具体的には、本発明による化合物によって防除することができる、いくつかの代表的な単子葉および双子葉の雑草相（weed flora）を例として言及してもよく、これらが特定の種への制限となることはない。活性化合物が効果的に作用を及ぼす雑草種の例は、単子葉植物からは、カラスムギ属（Avena）、ドクムギ属（Lolium）、スズメノテッポウ属（Alopecurus）、ファラリス（Phalaris）、ヒエ属（Echinochloa）、メヒシバ属（Digitaria）、セタリア属（Setaria）、同様に一年生植物のカヤツリグサ属（Cyperus）および多年生植物からは、コムギダマシ属（Agropyron）、ギョウギシバ属（Cynodon）、チガヤ(Imperata)およびモロコシ属（Sorghum）、同様に多年生植物のカヤツリグサ属（Cyperus）である。

【００２３】

双子葉植物の雑草種の場合、活性範囲は、例えばヤエムグラ属（Galium）、スミレ属（

Viola）、クワガタソウ属（Veronica）、オドリコソウ属（Lamium）、コハコベ属（Stellaria）、アマランサス（Amaranthus）、シロガラシ属（Sinapis）、サツマイモ属（Ipomoea）、キシゴジカ属（Sida）、シカギク属（Matricaria）および多年生植物からのアブチロン属（Abutilon）ならびに多年生雑草の場合、セイヨウヒルガオ属（Convolvulus）、アザミ属（Cirsium）、スイバ属（Rumex）およびヨモギ属（Artemisia）に及ぶ。また、本発明による活性化合物は、稲作という特定の状態下で発生する、例えば、イヌビエ（Echinochloa）、オモダカ属（Sagittaria）、サジオモダカ属（Alisma）、ハリイ属（Eleocharis）、ホタルイ属（Scirpus）およびカヤツリグサ属（Cyperus）などの有害植物の顕著な防除も達成する。発明による化合物を発芽前に土壌表面に適用した場合、雑草の苗の出現は完全に防止されるか、または雑草は子葉段階に達するまで成長するが、その後成長が止み、次第に３～４週間経過すると完全に枯死する。発明による化合物を発芽前に土壌表面に適用した場合、雑草の苗の出現は完全に防止されるか、または雑草は子葉段階に達するまで成長するが、その後成長が止み、次第に３～４週間経過すると完全に枯死する。特に、本発明による化合物は、セイヨウヌカボ属（Apera spica venti）、シロザ（Chenopodium album）、ヒメオドリコソウ（Lamium purpureum）、ソバカズラ（Polygonum convulvulus）、コハコベ（Stellaria media）、フラサバソウ（Veronica hederifolia）、オオイヌフグリ（Veronica persica）、サンシキスミレ（Viola tricolor）に対して、ならびにアマランサス（Amaranthus）、ヤエムグラ属（Galium）およびコキア（Kochia）種に対して優れた活性を呈する。

【００２４】

本発明による化合物は単子葉および双子葉の雑草に対して優れた除草効果を有するものの、例えば、小麦、大麦、ライ麦、コメ、トウモロコシ、テンサイ、綿およびダイズなどの経済的に重要な作物は全く損傷されないか、またはその損傷は無視できる程度である。特に、それらは例えば、小麦、大麦、トウモロコシなどの作物、特に小麦で優れた適合性を有する。これらの理由で、本化合物は、農業利用のための植え付けまたは観葉植物の植え付けで望ましくない植物成長を選択的に防除するのに非常に好適である。

【００２５】

それらの除草特性のために、これら活性化合物は、既知の遺伝子組換え植物または未だ開発されていない遺伝子組換え植物の作物中の有害植物を防除するために使用してもよい。一般にトランスジェニック植物は、特に有意な特性、例えば、特定の殺虫剤、具体的には特定の除草剤への耐性、植物病害あるいは、特定の昆虫もしくは菌類、細菌またはウイルスなどの微生物などの植物病害の原因細菌への耐性を有している。他の特別の特性は、例えば、量、品質、保存安定性、組成および収穫製品の特定の成分に関している。したがって、増加したデンプン含量または組換え品質のデンプンを有するトランスジェニック植物または収穫製品の異なる脂肪酸組成を有するものが既知である。

【００２６】

本発明による式(I)の化合物またはそれらの塩の使用は、好ましくは、有用な植物および観葉植物（例えば、小麦、大麦、ライ麦、オーツ麦、キビ、コメ、キャッサバおよびトウモロコシなどの作物）の経済的に重要なトランスジェニック作物で行うか、またはテンサイ、綿、ダイズ、菜種、ジャガイモ、トマト、マメおよび他の野菜種の作物で行う。式(I)の化合物は、好ましくは、除草剤の植物毒素効果に耐性であるか、遺伝子操作によって耐性が付与された有用な植物の作物中の除草剤として使用することができる。

【００２７】

既知の植物と比較して組換え特性を有する新規の植物を製造する従来の方法は、例えば、伝統的な育種法および突然変異体の生成を含んでなる。あるいは、組換え特性を有する新規の植物は遺伝子工学方法を用いて生成することができる(例えば、EP-A 0 221 044、EP-A 0 131 624を参照のこと)。例えば、植物中に合成されたデンプンを組換えることを目的とした、作物植物中の遺伝子操作変化（例えば、WO 92/11376、WO 92/14827、WO 91/19806)、グルホシネート(グルホシネートアンモニウム）(例えば、EP-A 0 242 236、EP-A 0 242 246を参照のこと)、グリフォサート型(WO 92/00377)またはスルホニル尿素型(EP-

A 0 257 993、米国特許第5,013,659号)の特定の除草剤に耐性であるトランスジェニック作物、植物に特定の有害生物への耐性を付与するバチルス・チューリンゲンシス（Bacillus thuringiensis）毒素（Ｂｔ毒素）を産生させる能力を有するトランスジェニック作物、例えば、綿（EP-A 0 142 924、EP-A 0 193 259）、組換え脂肪酸粗製を有するトランスジェニック作物（WO 91/13972）のいくつかの事例が記載されている。

【００２８】

組換え特性を有する新規のトランスジェニック植物の製造を可能にする多数の分子生物学技術は基本的に既知である;例えば、Sambrook et al., 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2nd ed. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, N.Y.; or Winnacker "Gene und Klone" [Genes and Clones], VCH Weinheim, 2nd edition 1996, or Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431を参照のこと。そのような遺伝子操作手技を実施するために、プラスミド中に核酸分子を導入することが可能であり、それによってＤＮＡ配列の組換えにより配列中での突然変異生成または変化の発生が可能となる。上述の標準的方法を使用して、例えば、塩基を置換して部分的配列を除去するか、あるいは天然または合成の配列を加えることが可能である。ＤＮＡ断片を互いに結合させるために、断片にアダプターまたはリンカーを付着させることができる。

【００２９】

遺伝子産物の活性が低減した植物細胞は、例えば、少なくとも１つの適当なアンチセンスＲＮＡ、センスＲＮＡを発現させて共抑制効果を達成することにより、または上述の遺伝子産物の転写物を特異的に開裂する、少なくとも１つの適当に構築されたリボザイムを発現させることによって製造することができる。

【００３０】

この目的のために、存在していてもよい任意のフランキング配列を含む遺伝子産物のコード配列全体を含んでなるＤＮＡ分子とコード配列の部分（これら部分は、細胞中のアンチセンス効果を引き起こすのに十分長い必要がある）のみを含んでなるＤＮＡ分子の両方を使用することが可能である。また、遺伝子産物のコード配列に高い相同性を有するが、完全に同一ではないＤＮＡ配列を使用することも可能である。

【００３１】

植物中で核酸分子を発現させる場合、合成されたタンパク質を、植物細胞の任意の所望の区画中に局地化することができる。しかしながら、特定の区画中で局在化を達成するために、例えば、コード領域を、特定の区画への局在化を確保するＤＮＡ配列と結合させることが可能である。そのような配列は、当業者に公知である（例えば、Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald et al., Plant J. 1 (1991), 95-106を参照のこと)。

【００３２】

トランスジェニック植物細胞は、既知の技術を使用して、完全植物に再生することができる。原則として、トランスジェニック植物は、任意の所望の植物種の植物、即ち、単子葉植物および双子葉植物両方であってもよい。このように、相同（＝天然）の遺伝子または遺伝子配列の過剰発現、抑制または阻害、あるいは異種（＝外来）の遺伝子または遺伝子配列の発現によって組換え特性を有するトランスジェニック植物を得ることが可能である。

【００３３】

本発明による活性化合物をトランスジェニック作物で使用する場合、他の作物で観察可能な有害な植物に対する効果に加えて、それぞれのトランスジェニック作物への適用に特異的な効果が頻繁にあり、それは例えば、組換え雑草または特異的に広範囲な雑草が防除可能であること、適用に用いることができる改良された適用率、トランスジェニック作物が耐性である除草剤との好ましく良好な化合性能ならびにトランスジェニック作物の成長および収量である。したがって、本発明は、トランスジェニック作物中の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化合物の使用をも提供する。

【００３４】

さらに、本発明による物質は作物での顕著な成長調節特性を有している。それらは植物代謝の調節に関与し、これを、例えば、乾燥および妨げられた成長を刺激することによって、植物構成物質の目標とする防除および収穫の促進に使用することができる。またさらに、それらはプロセスにおいて植物を破壊せずに、所望しない植物成長を通常調節し抑制するのに好適である。植物成長の抑制は、単子葉および双子葉の作物に重要な役割を果たし、その理由としては、これによって倒伏を減少させるかまたは完全に防止することができるためである。

【００３５】

本発明による化合物は水和剤（wettable powders）、乳剤（emulsifiable concentrate）、噴霧可能溶液、粉末または顆粒の形態での慣習的な製剤で適用することができる。したがって、本発明は、式（Ｉ）の化合物を含んでなる除草組成物をも提供する。式（Ｉ）の化合物は、普及している生物学的および／または物理化学的なパラメーターに依存する種々の方法で製剤化することができる。好適な製剤の選択肢の例は次のとおりである：水和剤（ＷＰ）、水溶性粉末（ＳＰ）、水溶性剤（water-soluble concentrate）、乳剤（ＥＣ）、水中油型乳剤および油中水型乳剤などの乳剤（ＥＷ）、噴霧可能溶液、懸濁剤（suspension concentrate）（ＳＣ）、油性分散剤または水性分散剤、油混和性溶液、粉末（ＤＰ）、カプセル懸濁剤（ＣＳ）、種子粉衣組成物、散布用および土壌適用用の顆粒剤、微粒剤の解体の顆粒剤（ＧＲ）、噴霧顆粒剤、粉衣顆粒剤および吸着顆粒剤、水分散性顆粒剤（ＷＧ）、水溶性顆粒剤（ＳＧ）、ＵＬＶ製剤、マイクロカプセルおよびワックス。これらの個々の製剤類型は原則としては既知であり、例えば、Winnacker-Kuhler, "Chemische Technologie" [Chemical Technology], Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4th. Edition 1986; Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations"、Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. Londonに記載されている。

【００３６】

例えば、不活性材料、界面活性剤、溶媒および他の添加剤などの必要な製剤助剤も同様に既知であり、例えば、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, "Grenzflchenaktive thylenoxidaddukte" [Surface-active ethylene oxide adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Kuchler, "Chemische Technologie" [Chemical Technology], Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4th Edition 1986に記載されている。

【００３７】

水和剤は、水中で均一に分散可能であって、かつ活性化合物と同様に希釈剤または不活性物質に加えて、イオン性および／または非イオン性型の界面活性剤(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類、ポリエトキシ化脂肪族アルコール類、ポリエトキシ化脂肪族アミン類、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類、アルカンスルホネート類、アルキルベンゼンスルホネート類、リグニンスルホン酸ナトリウム、２，２’－ジナフチルメタン－６，６’－二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またはオレオイルメチルタウリン酸ナトリウムを含有する調合物である。水和剤を調製するために、例えば、ハンマー製粉機、ファン型製粉機および空気ジェット粉砕機などの慣習的な装置で除草活性化合物を微細に製粉し、製剤助剤との混合を同時に行うか、またはその後に行う。

【００３８】

乳剤は、1つ以上のイオン性および／または非イオン性型の界面活性剤(乳化剤)を添加して、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、キシレンまたは比較的高沸点の芳香族化合物または炭化水素あるいは溶媒の混合物)中で活性

化合物を溶解させることによって調製する。使用することができる乳化剤の例は、Caドデシルベンゼンスルホネートなどのアルキルアリールスルホン酸カルシウム類または脂肪酸ポリグリコールエステル類などの非イオン性乳化剤、アルキルアリールポリグリコールエーテル類、脂肪族アルコールポリグリコールエーテル類、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類、ソルビタンエステル類、例えば、ソルビタン脂肪酸エステル類またはポリオキシエチレンソルビタンエステル類、例えば、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステルである。

【００３９】

粉末は、活性化合物を、微粉化した固形物質(例えば、滑石、自然な粘土、例えば、カオリン、ベントナイトおよび葉ろう石など、またはケイソウ土)で粉砕することにより得られる。懸濁剤は、水性または油性でもよい。それらは、例えば、他の製剤類型の場合で、例えば、既に上記した界面活性剤を加えても加えなくても、市販の慣習的なビーズ粉砕機を使用した湿式ミル挽きによってて調製することができる。

【００４０】

乳剤、例えば、水中油型乳剤(EW)は、例えば、他の製剤類型の場合で、例えば、水性の有機溶媒および所望に応じて既に上記した界面活性剤を使用して、撹拌機、コロイド粉砕機および／または静的ミキサーによって調製することができる。

【００４１】

顆粒剤は、活性化合物を吸収性、顆粒化不活性物質上に噴霧するか、または活性化合物を、ポリビニルアルコール、ポリアクリル酸ナトリウムまたは鉱油などの粘着性バインダーによって、砂、カオリナイトまたは顆粒化不活性物質などの担体の表面上に適用することによって調製することができる。同様に好適な活性化合物も、必要に応じて肥料と混合して、慣習的な肥料顆粒剤の調製方法で粒状にすることもできる。一般的に水分散性顆粒剤は、噴霧乾燥、流動床造粒、ディスク造粒、高速ミキサーを使用する混合および固形不活性物質無しの押出しなどの慣習的方法によって調製される。

【００４２】

ディスク、流動床、押出しおよび噴霧による顆粒剤の調製については、例えば、"Spray-Drying Handbook" 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J. E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967、147ページ以降; "Perry’s Chemical Engineer’s Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, pp. 8-57に記載の方法を参照のこと。作物保護製品の製剤に関するさらなる詳述は、例えば、G. C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons Inc., New York, 1961、81-96ページおよびJ. D. Freyer, S. A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968、101-103ページを参照のこと。

【００４３】

概して農薬製剤は、式(I)の活性化合物を、0.1～99重量%、具体的には0.1～95重量%含有する。水和剤では、活性化合物の濃度は、例えば、約10～90重量%であって、慣習的な製剤構成物質からなる残余物は100重量%までである。乳剤では、活性化合物の濃度は、例えば、約1～90重量%、好ましくは5～80重量%であってよい。粉末形態の製剤は、活性化合物を1～30重量%、好ましくは最も一般的に活性化合物を5～20重量%含有し、一方で噴霧可能溶液は、活性化合物を約0.05～80重量%、好ましくは2～50重量%含有する。水分散性顆粒剤の場合、活性化合物の含有量は、活性化合物が液体または固体の形態であるか、および使用した造粒化助剤、フィラーに部分的に依存する。水分散性顆粒剤では、活性化合物の含有量は、例えば、1～95重量%の間、好ましくは10～80重量%の間である。

【００４４】

さらに、前記活性化合物の製剤は、それぞれが慣習的なものである、粘着付与剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、浸透剤、保存剤、不凍剤、溶媒、フィラー、担体、着色剤、泡止剤、蒸発抑制剤、pH調節剤および粘性調節剤を含んでいてもよい。

【００４５】

これらの製剤に基づいて、例えば、成分調合済みまたはタンク混合の形態で、他の殺虫

性活性物質、例えば、殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤および殺真菌剤、同様に解毒剤、肥料および／または成長調節物質と一緒に組合わせ物を生産することも可能である。

【００４６】

混合製剤またはタンク混合での、本発明による活性化合物と組み合わせることができる好適な活性化合物は、例えば、World Herbicide New Product Technology Handbook, China Agricultural Science and Farming Techniques Press, 2010.9およびそこで引用されている文献に記載されている既知の活性化合物である。例えば、式（Ｉ）の化合物と組み合わせることができる除草剤として、次の活性化合物に言及してもよい（注：化合物は、国際標準化機構（ＩＳＯ）に従った「慣用名」または、適切な場合、慣習的なコード番号と一緒に化学名によって名づけられている）：アセトクロール、ブタクロール、アラクロール、プロピソクロール、メトラクロール、ｓ－メトラクロール、プレチラクロール、プロパクロール、エタクロール（ethachlor）、ナプロパミド（napropamide）およびＲ－左ナプロパミド（R-left handed napropamide）、プロパニル、メフェナセット、ジフェナミド、ジフルフェニカン、エタプロクロール（ethaprochlor）、ベフルブタミド（beflubutamid）、ブロモブチド（bromobutide）、ジメテナミド、ジメテナミド－Ｐ、エトベンザニド、フルフェナセト（flufenacet）、テニルクロール、メタザクロール（metazachlor）、イソキサベン（isoxaben）、フラムプロプ－Ｍ－メチル（flamprop-M-methyl）、フラムプロプ－Ｍ－プロピル（flamprop-M-propyl）、アリドクロル、ペトキサミド（pethoxamid）、クロラノクリル（chloranocryl）、シプラジン（cyprazine）、メフルイジド、モナリド（monalide）、デラクロール（delachlor）、プリナクロール（prynachlor）、テルブクロール（terbuchlor）、キシラクロール（xylachlor）、ジメタクロール（dimethachlor）、シサニリド（cisanilide）、トリメキサクロール（trimexachlor）、クロメプロプ（clomeprop）、プロピザミド、ペンタノクロール（pentanochlor）、カルベタミド、ベンゾイルプロプ-エチル、シプラゾール、ブテナクロール（butenachlor）、テブタム（tebutam）、ベンジプラム（benzipram）、１３７９、ジクロフルアニド、ナプロアニリド、ジエタチル-エチル（diethatyl-ethyl）、ナプタラム、フルフェナセト（flufenacet）、ベンザドクス、クロールチアミド、クロロフタルイミド、イソカルバミド、ピコリナフェン（picolinafen）、アトラジン、シマジン、プロメトリン、シアナトリン（cyanatryn）、シメトリン、アメトリン、プロパジン、ジプロペトリン、ＳＳＨ－１０８、テルブトリン、ターブチルアジン（terbuthylazine）、トリアジフラム（triaziflam）、シプラジン（cyprazine）、プログリナジン（proglinazine）、トリエタジン（trietazine）、プロメトン、シメトン（simetone）、アジプロトリン（aziprotryne）、デスメトリン、ジメタメトリン、プロシアジン（procyazine）、メソプラジン（mesoprazine）、セブチラジン（sebuthylazine）、セクブメトン、テルブメトン、メトプロトリン（methoprotryne）、シアナトリン（cyanatryn）、イパジン（ipazine）、クロラジン（chlorazine）、アトラトン（atraton）、ペンディメタリン、エグリナジン（eglinazine）、シアヌル酸、インダジフラム（indaziflam）、クロルスルフロン、メトスルフロン－メチル、ベンスルフロンメチル（bensulfuron methyl）、クロリムロン－エチル、トリベヌロン－メチル、チフェンスルフロン-メチル（thifensulfuron-methyl）、ピラゾスルフロン-エチル（pyrazosulfuron-ethyl）、メソスルフロン（mesosulfuron）、ヨードスルフロン-メチル・ナトリウム（iodosulfuron-methyl sodium）、フォラムスルフロン（foramsulfuron）、シノスルフロン（cinosulfuron）、トリアスルフロン（triasulfuron）、スルホメツロン・メチル（sulfometuron methyl）、ニコスルフロン（nicosulfuron）、エタメトスルフロン-メチル（ethametsulfuron-methyl）、アミドスルフロン（amidosulfuron）、エトキシスルフロン、シクロスルファムロン、リムスルフロン（rimsulfuron）、アジムスルフロン、フラザスルフロン、モノスルフロン（monosulfuron）、モノスルフロン-エステル（monosulfuron-ester）、フルカルバゾン-ナトリウム（flucarbazone-sodium）、フルピルスルフロン-メチル（flupyrsulfuron-methyl）、ハロスルフロン－メチル、オキサスルフロン（oxasulfuron）、イマゾスルフロン、プリミスルフロン（primisulfuron）、プロポキシカルバゾン（propoxycarbazone）、プロスルフロン（prosulfuron）、スルホ

スルフロン（sulfosulfuron）、トリフロキシスルフロン（trifloxysulfuron）、トリフルスルフロン－メチル（triflusulfuron-methyl）、トリトスルフロン（tritosulfuron）、メトスルフロンメチル・ナトリウム（sodium metsulfuron methyl）、フルセトスルフロン（flucetosulfuron）、ＨＮＰＣ－Ｃ、オルトスルファムロン（orthosulfamuron）、プロピリスルフロン（propyrisulfuron）、メタゾスルフロン（metazosulfuron）、アシフルオルフェン（acifluorfen）、フォメサフェン（fomesafen）、ラクトフェン（lactofen）、フルオログリコフェン（fluoroglycofen）、オキシフルオルフェン（oxyfluorfen）、クロルニトロフェン、アクロニフェン（aclonifen）、エトキシフェン-エチル（ethoxyfen-ethyl）、ビフェノックス、ニトロフルオルフェン（nitrofluorfen）、クロメトキシフェン（chlomethoxyfen）、フルオロドイフェン、フルオロニトロフェン（fluoronitrofen）、フリルオキシフェン（furyloxyfen）、ニトロフェン、ＴＯＰＥ、ＤＭＮＰ、ＰＰＧ１０１３、ＡＫＨ－７０８８、ハロサフェン（halosafen）、クロルトルロン（chlortoluron）、イソプロツロン（isoproturon）、リニュロン、ジウロン、ダイムロン、フルオメツロン、ベンズチアズロン、メタベンズチアズロン、クミルロン、エチジムロン（ethidimuron）、イソウロン（isouron）、テブチウロン、ブツロン（buturon）、クロルブロムロン、メチルジムロン（methyldymron）、フェノベンズロン（phenobenzuron）、ＳＫ－８５、メトブロムロン、メトクスロン（metoxuron）、アフェシン（afesin）、モヌロン、シズロン、フェヌロン、フルオチウロン（fluothiuron）、ネブロン、クロロクスロン、ノルロン（noruron）、イソノルロン（isonoruron）、３－シクロオクチル－１、チアズフルロン（thiazfluron）、テブチウロン、ジェノクスロン（difenoxuron）、パラフルロン（parafluron）、メチルアミントリブニル（methylamine tribunil）、カルブチラート、トリメツロン（trimeturon）、ジメフロン（dimefuron）、モノイソウロン（monisouron）、アニスロン（anisuron）、メチウロン（methiuron）、クロルエツロン（chloreturon）、テトラフルロン（tetrafluron）、フェンメジファム、フェンメジファム-エチル、デスメディファム、アスラム、テルブカルブ（terbucarb）、バルバン、プロファム、クロルプロファム、ロウメート（rowmate）、スウェプ（swep）、クロルブファム（chlorbufam）、カルボキサゾール、クロルプロカルブ（chlorprocarb）、フェナスルファム（fenasulam）、ＢＣＰＣ、ＣＰＰＣ、カルバスルファム（carbasulam）、ブチレート、ベンチオカルブ、ベルノレート、モリネート、トリアレート、ジメピペレート（dimepiperate）、エスプロカルブ、ピリブチカルブ、シクロアート、アバデクス（avadex）、ＥＰＴＣ、エチオレート、オルベンカルブ（orbencarb）、ペブレート、プロスルホカルブ（prosulfocarb）、チオカルバジル（tiocarbazil）、ＣＤＥＣ、ジメキサノ（dimexano）、イソポリネート（isopolinate）、メチオベンカルブ（methiobencarb）、２，４－Ｄブチルエステル、ＭＣＰＡ－Ｎａ、２，４－Ｄイソオクチルエステル、ＭＣＰＡイソオクチルエステル、２，４－Ｄナトリウム塩、２，４－Ｄジメチルアミン塩（2,4-D dimethyla mine salt）、ＭＣＰＡ－チオエチル、ＭＣＰＡ、２，４－Ｄプロピオン酸、高２，４－Ｄプロピオン酸塩、２，４－Ｄ酪酸、ＭＣＰＡプロピオン酸、ＭＣＰＡプロピオン酸塩、ＭＣＰＡ酪酸、２，４，５－Ｄ、２，４，５－Ｄプロピオン酸、２，４，５－Ｄ酪酸、ＭＣＰＡアミン塩、ジカンバ、エルボン、クロルフェナク（chlorfenac）、セゾン（saison）、TBA、クロラムベン、メトキシ－TBA、ジクロフォップ-メチル、フルアジホップ・ブチル、フルアジホップ－p-ブチル、ハロキシホップ－メチル、ハロキシホップ－P、キザロホップ－エチル、キザロホップ-p-エチル（quizalofop-ethyl）、フェノキサプロプ－エチル（fenoxaprop-ethy）、フェノキサプロプ-p－エチル（fenoxaprop-p-ethyl）、プロパキザホップ（propaquizafop）、シハロホップ－ブチル、メタミホップ（metamifop）、クロジナホップ-プロパルギル（clodinafop-propargyl）、フェンチアプロプ-エチル（fenthiaprop-ethyl）、クロロアジホップ（chloroazifop-propynyl）、ポッペナート-メチル（poppenate-methyl）、トリホプシメ（trifopsime）、イソキサピリホップ（isoxapyrifop）、パラコート、ジクワット、オリザリン（oryzalin）、エタルフルラリン（ethalfluralin）、イソプロパリン（isopropalin）、ニトラリン、プロフルラリン、プロジナミン（prodinamine）、ベンフルラリン（benfluralin）、フルクロラリン（fluchloral

ine）、ジニトラミナ（dinitramina）、ジプロパリン（dipropalin）、クロルニジン（chlornidine）、メタルプロパリン（methalpropalin）、ジノプロプ（dinoprop）、グリフォサート、アニロホス、グルホシネート・アンモニウム、アミプロホスメチル、スルホセート（sulphosate）、ピペロフォス（piperophos）、ビアラフォス-ナトリウム（bialaphos-sodium）、ベンスリド、ブタミホス、フォカルブ（phocarb）、２，４－ＤＥＰ、Ｈ－９２０１、ジトロン（zytron）、イマザピル（imazapyr）、イマゼタピル（imazethapyr）、イマザキン（imazaquin）、イマザモックス（imazamox）、イマザモックス・アンモニウム塩（imazamox ammonium salt）、イマザピック（imazapic）、イマザメタベンズ-メチル（imazamethabenz-methyl）、フルオキシピル（fluroxypyr）、フルオキシピル・イソオクチル・エステル（fluroxypyr isooctyl ester）、クロピラリド（clopyralid）、ピクロラム、トリクロピル（trichlopyr）、ジチオピル（dithiopyr）、ハロキシジン（haloxydine）、３，５，６－トリクロロ－２－ピリジノール、チアゾピル（thiazopyr）、フルリドン、アミノピラリド（aminopyralid）、ジフルフェンゾピル（diflufenzopyr）、トリクロピル－ブトチル（triclopyr-butotyl）、クリオジネート（Cliodinate）、セトキシジム、クレトジム、シクロキシジム、アロキシジム（alloxydim）、クレホキシジム（clefoxydim）、ブトロキシジム（butroxydim）、トラルコキシジム（tralkoxydim）、テプラロキシジム、ブチダゾール（buthidazole）、メトリブジン、ヘキサジノン（hexazinone）、メタミトロン、エチオジン（ethiozin）、アメトリジオン（ametridione）、アミブジン（amibuzin）、ブロモキシニル、オクタン酸ブロモキシニル、オクタン酸イオキシニル、イオキシニル、ジクロベニル、ジフェナトリル、ピラクロニル、クロロキシニル（chloroxynil）、ヨードボニル（iodobonil）、フルメトスルファム（flumetsulam）、フロラスルファム（florasulam）、ペノキススラム、メトスルファム（metosulam）、クロランスルファム-メチル（cloransulam-methyl）、ジクロスルファム（diclosulam）、ピロクススルファム（pyroxsulam）、ベンフレセート、ビスピリバックナトリウム塩、ピリベンゾキシム（pyribenzoxim）、ピリフタリド、ピリミノバック－メチル、ピリチオバック-ナトリウム、ベンゾビシロン（benzobicylon）、メソトリオン（mesotrione）、スルコトリオン（sulcotrione）、テンボトリオン（tembotrione）、テフリルトリオン（tefuryltrione）、ビシクロピロン（bicyclopyrone）、ケトピラドクス（ketodpiradox）、イソキサフルトール（isoxaflutole）、クロマゾン（clomazone）、フェノキサスルホン（fenoxasulfone）、メチオゾリン（methiozolin）、フルアゾレート（fluazolate）、ピラフルフェン－エチル、ピラゾリネート、ジフェンゾコート、ピラゾキシフェン、ベンゾフェナプ（benzofenap）、ニピラクロフェン（nipyraclofen）、ピラスルホトール（pyrasulfotole）、トプラメゾン（topramezone）、ピロキサスルフォン（pyroxasulfone）、カフェンストロール、フルポキサム（flupoxam）、アミノトリアゾール、アミカルバゾン（amicarbazone）、アザフェニジン、カルフェントラゾンエチル、スルフェントラゾン（sulfentrazone）、ベンカルバゾン（bencarbazone）、ベンズフェンジゾン（benzfendizone）、ブタフェナシル、ブロマシル、イソシル、レナシル、ターバシル、フルプロパシル（flupropacil）、シニドンエチル、フルミクロラク-ペンチル（flumiclorac-pentyl）、フルミオキサジン、プロピザミド、ＭＫ－１２９、フルメジン（flumezin）、ペンタクロロフェノール、ジノセブ、ジノテルブ（dinoterb）、酢酸ジノテルブ（dinoterb acetate）、ジノサム（dinosam）、DNOC、クロロニトロフェン（chloronitrophene）、酢酸メジノテルブ、ジノフェナート（dinofenate）、オキサジアルギル、オキサジアゾン、ペントキサゾン、フルフェナセト（Flufenacet）、フルチアセットメチル、フェントラザミド、フルフェンピル-エチル（flufenpyr-ethyl）、ピラゾン、ブロムピラゾン（brompyrazon）、メトフルラゾン（metflurazon）、クサキラ（kusakira）、ジミダゾン（dimidazon）、オキサピラゾン、ノルフルラゾン、ピリダホル（pyridafol）、キンクロラック、キンメラック（quinmerac）、ベンタゾン、ピリデート、オキサジクロメホン、ベナゾリン（benazolin）、クロマゾン（clomazone）、シンメチリン、ＺＪ０７０２、ピリバムベンズ－プロピル、インダノファン、塩素酸ナトリウム、ダラポン、トリクロロ酢酸、モノクロロ酢酸、ヘキサクロロアセトン、フルプロパネート、シペルクアット（cyperquat）、

ブロモフェノキシム、エプロナズ、メタゾール、フルルタモン（flurtamone）、ベンフレセート、エソフメセート（ethofumesate）、チオクロリム（tioclorim）、クロルタール（chlorthal）、フルオロクロリドン、タブロン（tavron）、アクロレイン、ベントラニル、トリジファン（tridiphane）、クロルフェンプロプメチル、チジアリゾナイミン（thidiarizonaimin）、フェニソファム（phenisopham）、ブソキシノン（busoxinone）、メトキシフェノン、サフルフェナシル（saflufenacil）、クラシホス（clacyfos）、クロロポン（chloropon）、アロラック（alorac）、ジエタムクアット（diethamquat）、エトニプロミド（etnipromid）、イプリミダム（iprymidam）、イプフェンカルバゾン（ipfencarbazone）、チエンカルバゾン-メチル（thiencarbazone-methyl）、ピリスルファン（pyrimisulfan）、クロルフルラゾール（chlorflurazole）、トリプロピンダン（tripropindan）、スルグリカピン（sulglycapin）、プロスルファリン（prosulfalin）、カムベンジクロール（cambendichlor）、アミノシクロピラクロール（aminocyclopyrachlor）、ロデタニル（rodethanil）、ベノキサコル（benoxacor）、フェンクロリム（fenclorim）、フルラゾール（flurazole）、フェンクロラゾール-エチル（fenchlorazole-ethyl）、クロキントセト－メキシル（cloquintocet-mexyl）、オキサベトリニル（oxabetrinil）、ＭＧ／９１、シオメトリニル（cyometrinil）、ＤＫＡ－２４、メフェンピル－ジエチル、フリラゾール（furilazole）、フキソフェニム（fluxofenim）、イソキサジフェン-エチル（isoxadifen-ethyl）、ジクロルミド（dichlormid）、ハラウキシフェン-メチル（halauxifen-methyl）、ＤＯＷ８４８、ＵＢＨ－５０９、Ｄ４８９、ＬＳ　８２－５５６、ＫＰＰ－３００、ＮＣ－３２４、ＮＣ－３３０、ＫＨ－２１８、ＤＰＸ－Ｎ８１８９、ＳＣ－０７４４、ＤＯＷＣＯ５３５、ＤＫ－８９１０、Ｖ－５３４８２、ＰＰ－６００、ＭＢＨ－００１、ＫＩＨ－９２０１、ＥＴ－７５１、ＫＩＨ－６１２７およびＫＩＨ－２０２３。

【００４７】

市販の形態で存在する、使用する製剤は、適切な場合、例えば、水和剤、乳剤、分散物および水分散性顆粒剤の場合での水の使用など、慣習的な方法で希釈する。粉末、土壌適用用または散布用の顆粒剤および噴霧可能な溶液の形態での生成物は、通常、使用に先立って他の不活性物質でさらに希釈しない。要求される式（Ｉ）の化合物の適用率は、温度、湿度、使用する除草剤の性質などの外部条件に応じて変化する。それは、広い範囲に及んでもよく、例えば、０．００１～１．０ｋｇ／ｈａの間、好ましくは０．００５～７５０ｇ／ｈａの間、特に０．００５～２５０ｇ／ｈａの間の反応性物質であってよい。

【実施例】

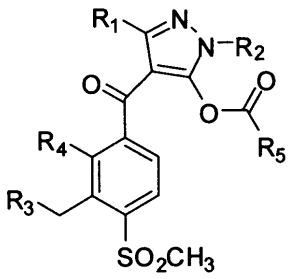
【００４８】

化合物の経済性、種類および生物活性を考慮して、我々は好ましくはいくつかの化合物を合成し、その一部を以下の表に列挙した。特定の化合物の構造および情報を表1に示す。表1中の化合物は、本発明の更なる説明のために列挙されるものであり、何ら限定されるものではない。当業者においては本発明の主題が次の化合物により限定されると解釈されるべきものでない。本発明と関係する物理的性質データはキャリブレーションされていない。

【００４９】

表１中の化合物構造および^{1}Ｈ　ＮＭＲデータ

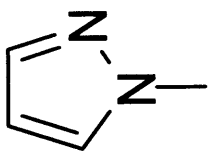
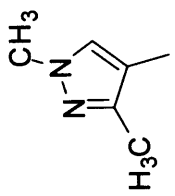
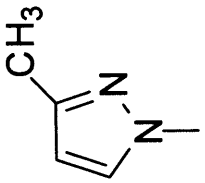
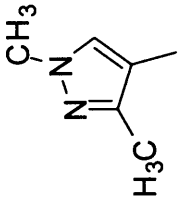
【化１０】



(I)

【００５０】

【表１】

番号	R_1	R_2	R_3	R_4	R_5	^{1}H NMR
01	$-CH_3$	$-CH_3$		$-Cl$		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.08 (s, 3H), 2,34 (s, 3H), 3.26 (s, 3H), 3.35 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.75 (s, 2H), 6.26 (s, 1H), 7.25 (s, 1H), 7.56 (s, 1H), 7.59 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.91 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 8.02 (s, 1H).
02	$-CH_3$	$-CH_3$		$-Cl$		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.09 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2,37 (s, 3H), 3.15 (s, 3H), 3.58 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.76 (s, 2H), 6.29 (s, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.58 (d, 1H, J

					= 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.03 (s, 1H).
03	—CH_3		—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.07 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 3.09 (s, 3H), 3.58 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 5.72 (s, 2H), 6.24 (s, 1H), 7.56 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.91 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.02 (s, 1H).
04	—CH_3		—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.99 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 3.07 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 5.74 (s, 2H), 7.24 (s, 1H), 7.54 (s,

						1H), 7.57 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.90 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 8.00 (s, 1H).
05	—CH_3	—CH_3		—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.24 (s, 3H), 2,36 (s, 3H), 3.25 (s, 3H), 3.58 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.72 (s, 2H), 7.28 (s, 1H), 7.56 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.93 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.99 (s, 1H), 8.05 (s, 1H).
06	—H	—CH_3		—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.13 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.58 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 5.79 (s, 2H), 7.20 (s, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.51 (s,

					1H), 7.56 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.95 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.08 (s, 1H).
07	—H	—CH_3		—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.00 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 3.08 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 5.76 (s, 2H), 7.26 (s, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.58 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.04 (s, 1H).
08	—H	—CH_3		—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.22 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 5.78 (s, 1H), 6.23 (s, 1H), 7.22 (s, 1H), 7.35

					(s, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.61 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.93 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.07 (s, 1H).
09		—CH_3		—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 0.67-1.42 (m, 4H), 2.12 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.42 (s, 1H), 3.16 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 5.83 (s, 2H), 6.26 (s, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.68 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.99 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 8.11 (s, 1H).
10		—CH_3		—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 0.60-1.39 (m, 4H), 2.23 (s, 3H), 2.39 (s, 1H), 3.14 (s, 3H), 3.53

11					^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 0.65-1.40 (m, 4H), 2.07 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 2.45 (s, 1H), 3.21 (s, 3H), 3.58 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.88 (s, 2H), 6.26 (s, 1H), 7.66 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.98 (d, 1H, J= 7.8 Hz), 8.07 (s, 1H).
					(s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.81 (s, 2H), 7.55 (s, 1H), 7.64 (d, 1H, J= 7.8 Hz), 7.93 (d, 1H, J= 7.8 Hz), 8.02 (s, 1H), 8.06 (s, 1H).

12		—CH_3		—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 0.69-1.45 (m, 4H), 1.99 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.43 (s, 1H), 3.15 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 5.85 (s, 2H), 6.24 (s, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.71 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.96 (d, 1H, J= 7.8 Hz), 8.08 (s, 1H).
13		—CH_3		—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 0.67-1.42 (m, 4H), 2.24 (s, 3H), 2.41(s, 1H), 3.17 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 5.83 (s, 2H), 6.25 (s, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.67 (d, 1H, J= 7.8 Hz), 7.95

					(d, 1H, J = 7.8 Hz), 8.05 (s, 1H), 8.10 (s, 1H).
14	—CH_3	—CH_3		—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.99 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2,36 (s, 3H), 3.10 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 5.70 (s, 2H), 7.22 (s, 1H), 7.53 (s, 1H), 7.58 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.72 (s, 1H), 7.91 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.08 (s, 1H).
15	—CH_3	—CH_3		—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.05 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 3.07 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 5.74 (s, 2H), 6.24 (s, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.57 (d,

						1H, J= 8.0 Hz), 7.71 (s, 1H), 7.90 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 8.10 (s, 1H).
16	—CH_3	—CH_3		—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.24 (s, 3H), 2,32 (s, 3H), 3.14 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 5.76 (s, 2H), 6.25 (s, 1H), 7.25 (s, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.56 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.75 (s, 1H), 7.89 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 8.09 (s, 1H).
17	—H	—CH_3		—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.99 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 3.08 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 5.76 (s, 2H), 7.26 (s, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.52

					(s, 1H), 7.58 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.71 (s, 1H), 7.92 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 8.04 (s, 1H).
18		—CH_3		—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 0.68–1.42 (m, 4H), 2.18 (s, 3H), 2.37 (s, 1H), 3.16 (s, 3H), 3.59 (s, 3H), 5.88 (s, 2H), 7.52 (s, 1H), 7.66 (d, 1H, J= 7.8 Hz), 7.78 (s, 1H), 7.93 (d, 1H, J= 7.8 Hz), 8.01 (s, 1H), 8.11 (s, 1H).
19		—CH_3		—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 0.71–1.48 (m, 4H), 2.20 (s, 3H), 2.36 (s, 1H), 3.15 (s, 3H), 3.64 (s, 3H), 5.87 (s,

					2H), 6.35 (s, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.62 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.74 (s, 1H), 7.93 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 8.04 (s, 1H), 8.10 (s, 1H).
					^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 0.69-1.43 (m, 4H), 2.12 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.39 (s, 1H), 3.27 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 5.86 (s, 2H), 6.29 (s, 1H), 7.60 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.76 (s, 1H), 7.91 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 8.08 (s, 1H).

21		—CH_3		—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 0.66-1.42 (m, 4H), 2.15 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.41 (s, 1H), 3.19 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 5.86 (s, 2H), 6.42 (s, 1H), 7.64 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.78 (s, 1H), 7.89 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.98 (s, 1H), 8.09 (s, 1H).
22		—CH_3		—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 0.63-1.41 (m, 4H), 1.99 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 2.40 (s, 1H), 3.21 (s, 3H), 3.59 (s, 2H), 5.82 (s, 1H), 7.26 (s, 1H), 7.60 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.75 (s, 1H), 7.87

					(d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.99 (s, 1H), 8.09 (s, 1H).
23	—H	—CH_3		—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.32 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 1.99 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 3.08 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 4.32 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 5.76 (s, 2H), 7.24 (s, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.61 (s, 1H), 7.65 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.94 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.99 (s, 1H).
24	—H	—CH_3		—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.30 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 2.14 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 3.15 (s, 3H), 4.30 (s, 3H), 7.58 (s, 1H), 7.99 (s, 1H).

					(q, 2H, J = 7.0 Hz), 5.76 (s, 2H), 6.24 (s, 1H), 7.47 (s, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.78 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.96 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.02 (s, 1H).
	—CH_3	—CH_3	—OCH_2CHF_2	—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.23 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.85–3.90 (td, 2H, J = 3.5 Hz, J_{HF} = 15.5 Hz), 5.04 (s, 2H), 6.11–6.33 (tt, 1H, J = 3.5 Hz, J_{HF} = 55 Hz), 7.63 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.10 (s, 1H).

26	—CH_3	—CH_3	—OCH_3	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.14 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 3.34 (s, 3H), 3.36 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.96 (s, 2H), 7.40 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.01 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.10 (s, 1H).
27	—CH_3	—CH_3	—OCH_2CH_3	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.14 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 2.18 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 3.36 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 3.55 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 3.77 (s, 3H), 4.98 (s, 2H), 7.45 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.98 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.06 (s, 1H).

28	$-CH_3$	$-CH_3$	$-OCH_2CH_2OCH_3$	$-Cl$		^1H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.12 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 3.18 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 3.49 (s, 3H), 3.50-3.58 (m, 4H), 3.72 (s, 3H), 5.04 (s, 2H), 7.55 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.99 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.09 (s, 1H).
29	$-CH_3$	$-CH_3$	$-OCH_2CF_3$	$-Cl$		^1H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.16 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 3.34 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.22 (q, 2H, J_{HF} = 9.0 Hz), 4.96 (s, 2H), 7.42 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.02 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.11 (s, 1H).

30	$-CH_2CH_3$	$-CH_3$		$-Cl$		^1H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.20 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 2.07 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.33 (q, 2H, J= 7.0 Hz), 3.09 (s, 3H), 3.58 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 5.72 (s, 2H), 6.24 (s, 1H), 7.56 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.91 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.02 (s, 1H).
31	$-CH_2CH_3$	$-CH_3$	$-OCH_2CH_3$	$-Cl$		^1H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.14-1.28 (m, 6H), 2.18 (s, 3H), 2.36 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 3.36 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 3.55 (q, 2H, J= 7.0 Hz), 3.77 (s, 3H), 4.98 (s, 2H), 7.45

					(d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.98 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.06 (s, 1H).
32	$-CH_2CH_3$	$-CH_3$	$-OCH_2CF_3$	—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ. 1.22 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 2.16 (s, 3H), 2.32 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 3.34 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.22 (q, 2H, J_{HF} = 9.0 Hz), 4.96 (s, 2H), 7.42 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.02 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.11 (s, 1H).
33	$-CH_3$	$-CH_3$	$HC\equiv C-CH_2O-$	—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.17 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 3.12 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.57 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.32 (s, 2H), 4.91

					(s, 2H), 7.54 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.84 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.90 (s, 1H).
34	—CH_3	—$OCH_2CH_2CH_2CH_3$	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 0.90 (s, 3H), 1.45-1.51 (m, 4H), 2.21 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 3.37 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.56 (t, 2H, J = 7.0 Hz), 3.78 (s, 3H), 4.99 (s, 2H), 7.58 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.96 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.10 (s, 1H).
35	—CH_3	—CH_3	—$OCH_2CF_2CHF_2$	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.23 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.96 (t, 2H, J_{HF}

					= 15 Hz), 5.04 (s, 2H), 5.89-6.11 (m, 1H), 7.63 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.11 (s, 1H).
36	—CH_3	—CH_3	$CH_3OCH_2CHCH_3$ (O)	—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.36 (d, 3H, J = 7.0 Hz), 2.14 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 3.32-3.39 (m, 4H), 3.40 (s, 3H), 3.61-3.67 (m, 5H), 3.78 (s, 3H), 4.96 (s, 2H), 7.40 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.01 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.10 (s, 1H).
37	—CH_3	—CH_3	—$OCH_2CH_2CH_2OCH_3$	—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 1.09 (m, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 3.18 (s, 3H), 3.45 (s,

					3H), 3.53-3.67 (m, 7H), 3.85 (s, 3H), 4.921 (s, 2H), 7.51 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.85 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 8.09 (s, 1H).
38	—CH_3	—CH_3	$H_3C-C(H)=C(H)-CH_2O-$	—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.95 (s, 3H), 2.14 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 3.34 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.92 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 5.28(s, 1H), 5.31 (s, 1H), 7.49 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.89 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.08 (s, 1H).
39	—CH_3	—CH_3	—$OCH_2CH_2OCH_2CH_3$	—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.10 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 2.21 (s, 3H), 2.32 (s,

40	—H	—CH_3	—OCH_2CHF_2	—Cl	
					^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.23 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.85–3.90 (td, 2H, J = 3.5 Hz, J_{HF} = 15.5 Hz), 5.04 (s, 2H), 6.11–6.33 (tt, 1H, J = 3.5 Hz, J_{HF} = 55 Hz), 7.63 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.10 (s, 1H).
					^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.23 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.45 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 3.51–3.57 (m, 4H), 3.67 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.14 (s, 2H), 7.65 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.89 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.04 (s, 1H).

41	—H	—CH_3	$HC{\equiv}C-CH_2O-$	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.42 (s, 3H), 3.12 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.57 (s, 1H), 3.74 (s, 3H), 4.32 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 7.54 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.71 (s, 1H), 7.84 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.98 (s, 1H).
42	—H	—CH_3	—OCH_2CH_3	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.14 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 2.25 (s, 3H), 3.36 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 3.55 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 3.77 (s, 3H), 4.98 (s, 2H), 7.45 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.63 (s, 1H), 7.98 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.06 (s, 1H).

43	—H	—CH_3	$H_3C-C\equiv C-CH_2O-$	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.95 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 3.34 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.92 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 5.28(s, 1H), 5.31 (s, 1H), 7.49 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.67 (s, 1H), 7.89 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 8.08 (s, 1H).
44	—H	—CH_3	—OCH_2CF_3	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.19 (s, 3H), 3.34 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.22 (q, 2H, J_{HF} = 9.0 Hz), 4.96 (s, 2H), 7.42 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.71 (s, 1H), 8.02 (d, 1H, J= 8.0 Hz),

					8.11 (s, 1H).
45	—H	—CH_3	—$OCH_2CH_2OCH_2CH_3$	—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.11 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 2.32 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.48 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 3.51–3.57 (m, 4H), 3.67 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.14 (s, 2H), 7.65 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.89 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.97 (s, 1H), 8.08 (s, 1H).
46		—CH_3	—OCH_2CH_3	—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 0.87–1.00 (m, 4H), 1.17 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 2.28 (s, 3H), 2.52 (s, 1H), 3.35 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.54 (q, 2H, J= 7.0 Hz), 3.72 (s, 3H), 5.01

						(s, 2H), 7.45 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.99 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.08 (s, 1H).
47		—CH_3	$HC{\equiv}C-CH_2O-$	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 0.90–1.01 (m, 4H), 2.28 (s, 3H), 2.51 (s, 1H), 3.15 (s, 3H), 3.52 (s, 3H), 3.59 (s, 1H), 3.84 (s, 3H), 4.33 (s, 2H), 4.93 (s, 2H), 7.57 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.85 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 8.10 (s, 1H).
48		—CH_3	$-OCH_2CF_2CHF_2$	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 0.90–1.01 (m, 4H), 2.23 (s, 3H), 2.51 (s, 1H), 3.19 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.96 (t, 2H, J_{HF}

					= 15 Hz), 5.04 (s, 2H), 5.89-6.11 (m, 1H), 7.63 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.11 (s, 1H).
49		—CH_3	—OCH_2CF_3	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 0.87-1.01 (m, 4H), 2.22 (s, 3H), 2.51 (s, 1H), 3.22 (s, 3H), 3.60 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.27 (q, 2H, J_{HF} = 9.0 Hz), 5.04 (s, 2H), 7.68 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.09 (s, 1H).
50		—CH_3	—OCH_2CHF_2	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 0.85-0.99 (m, 4H), 2.23 (s, 3H), 2.52 (s, 1H), 3.19 (s, 3H), 3.68

51		—CH_3	—OCH_3	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 0.88–1.05 (m, 4H), 2.23 (s, 3H), 2.52 (s, 1H), 3.34 (s, 3H), 3.36 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.96 (s, 2H), 7.40 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.01 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.10 (s, 1H).
						(s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.85–3.90 (td, 2H, J = 3.5 Hz, J_{HF} = 15.5 Hz), 5.04 (s, 2H), 6.11–6.33 (tt, 1H, J = 3.5 Hz, J_{HF} = 55 Hz), 7.63 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.10 (s, 1H).

52		—CH_3	—$OCH_2CH_2CH_2OCH_3$	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 0.90-1.01 (m, 4H), 1.09 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.51 (s, 1H), 3.17 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.56-3.69 (m, 7H), 3.84 (s, 3H), 4.91 (s, 2H), 7.52 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.85 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 8.10 (s, 1H).
53	—H	—CH_3	—$OCH_2CH_2CH_2OCH_3$	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 1.08 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.54-3.68 (m, 7H), 3.84 (s, 3H), 4.91 (s, 2H), 7.53 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.70 (s, 1H), 7.86 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 8.10 (s, 1H).

54	—H	—CH_3	—OCH_2CF_3	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.32 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 3.23 (s, 3H), 3.61 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 4.26 (q, 2H, J_{HF} = 9.0 Hz), 4.32 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 5.14 (s, 2H), 7.61 (s, 1H), 7.65 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.94 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.98 (s, 1H).
55	—CH_3	—CH_3	—OCH_2CF_3	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.33 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 2.32 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.60 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.27 (q, 2H, J_{HF} = 9.0 Hz), 4.35 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 5.14 (s, 2H), 7.68 (d, 1H, J = 8.0

					Hz), 7.95 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.99 (s, 1H).
56	—CH_3	—CH_3	$HC\equiv C-CH_2O-$	—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.32 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 2.21 (s, 3H), 3.12 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.57 (s, 1H), 3.74 (s, 3H), 4.26 (s, 2H), 4.41 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 4.91 (s, 2H), 7.59 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.91 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 8.02 (s, 1H).
57	—H	—CH_3	—OCH_2CHF_2	—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.38 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 3.19 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.85–3.90 (td, 2H, J = 3.5 Hz, J_{HF} = 15.5

58	—H	—CH_3	$HC\equiv C-CH_2O-$	—Cl	
					^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.32 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 3.12 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.57 (s, 1H), 3.74 (s, 3H), 4.26 (s, 2H), 4.41 (q, 2H, J= 7.0 Hz), 4.91 (s, 2H), 7.59 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.91 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.98 (s, 1H), 8.02 (s, 1H).
					Hz), 4.45 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 5.04 (s, 2H), 6.11–6.33 (tt, 1H, J= 3.5 Hz, J_{HF} = 55 Hz), 7.63 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.99 (s, 1H), 8.02 (s, 1H).

59	—H	—CH_3	—$OCH_2CH_2OCH_2CH_3$	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.10 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 1.32 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 3.23 (s, 3H), 3.42 (q, 2H, J= 7.0 Hz), 3.51-3.57 (m, 4H), 3.67 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.32 (q, 2H, J= 7.0 Hz), 5.14 (s, 2H), 7.65 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.89 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.97 (s, 1H), 8.01 (s, 1H).
60		—CH_3	$HC\equiv C-CH_2O-$	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 0.90-1.01 (m, 4H), 2.51 (s, 1H), 3.15 (s, 3H), 3.52 (s, 3H), 3.59 (s, 1H), 3.84 (s, 3H), 4.33 (s, 2H), 4.93 (s, 2H), 7.57

					(d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.69 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 8.10 (s, 1H).
61	—H	—CH_3	$HC{\equiv}C{-}CH_2O{-}$	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 3.10 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.61 (s, 1H), 3.77 (s, 3H), 4.35 (s, 2H), 4.92 (s, 2H), 7.58 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.81 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.89 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.02 (s, 1H).
62	—H	—CH_3	—$OCH_2CH_2CH_2OCH_3$	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 1.09 (m, 2H), 3.17 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.56-3.69 (m, 7H), 3.84 (s, 3H), 4.91 (s, 2H), 7.52 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.70

					(s, 1H), 7.85 (d, 1H, J= 7.8 Hz), 7.96 (s, 1H), 8.10 (s, 1H).
63	—CH_3	—CH_3	—OCH_2CF_3	—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.21 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.61 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 4.26 (q, 2H, J_{HF} = 9.0 Hz), 5.14 (s, 2H), 7.65 (s, 1H), 7.65 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.94 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 8.01 (s, 1H).
64	—CH_3	—CH_3	—OCH_2CHF_2	—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.33 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.85–3.90 (td, 2H, J= 3.5 Hz, J_{HF} = 15.5 Hz), 5.04 (s, 2H), 6.11–6.33

						(tt, 1H, J = 3.5 Hz, J_{HF} = 55 Hz), 7.63 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.99 (s, 1H), 8.10 (s, 1H).
65	—CH_3	—$OCH_2CF_2CHF_2$	—Cl			^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.36 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.96 (t, 2H, J_{HF} = 15 Hz), 5.04 (s, 2H), 5.89–6.11 (m, 1H), 7.63 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.10 (s, 1H).
66	—CH_3	—CH_3	—Cl			^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 1.09 (m, 2H), 2.41 (s, 3H), 3.17 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.56–3.69

					(m, 7H), 3.84 (s, 3H), 4.91 (s, 2H), 7.52 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.70 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 8.10 (s, 1H).
67	—H	—CH_3	—OCH_2CF_3	—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 3.18 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 4.28 (q, 2H, J_{HF} = 9.0 Hz), 5.14 (s, 2H), 7.61 (s, 1H), 7.65 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.94 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.98 (s, 1H), 8.09 (s, 1H).
68	—H	—CH_3	—$OCH_2CH_2OCH_2CH_3$	—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.11 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 3.13 (s, 3H), 3.48 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 3.51–3.57 (m, 4H),

					3.67 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.14 (s, 2H), 7.65 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.89 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.97 (s, 1H), 8.01 (s, 1H), 8.10 (s, 1H).
69	—CH_3	HC≡C–CH_2O—	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.27 (s, 3H), 3.12 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.57 (s, 1H), 3.74 (s, 3H), 4.32 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 7.54 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.84 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.90 (s, 1H), 7.99 (s, 1H).
70		—CH_3	—OCH_2CH_3	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 0.92–1.05 (m, 4H), 1.14 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 2.51 (s, 1H), 3.36 (s,

71		—CH_3	—$OCH_2CF_2CHF_2$	—Cl	
					^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 0.89–1.01 (m, 4H), 2.52 (s, 1H), 3.19 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.96 (t, 2H, J_{HF} = 15 Hz), 5.04 (s, 2H), 5.89–6.11 (m, 1H), 7.63 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.01 (s, 1H), 8.10 (s, 1H).
					3H), 3.41 (s, 3H), 3.55 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 3.77 (s, 3H), 4.98 (s, 2H), 7.45 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.79 (s, 1H), 7.98 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.06 (s, 1H).

72		—CH_3	—OCH_3	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 0.91-1.03 (m, 4H), 2.51 (s, 1H), 3.34 (s, 3H), 3.36 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.96 (s, 2H), 7.40 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.74 (s, 1H), 8.01 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.10 (s, 1H).
73	—CH_3	—CH_3	—OCH_2CH_3	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.14 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 2.21 (s, 3H), 3.36 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 3.55 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 3.77 (s, 3H), 4.98 (s, 2H), 7.45 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.77 (s, 1H), 7.98 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.08 (s, 1H).

74		—CH_3	—$OCH_2CH_2OCH_2CH_3$	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 0.92-1.00 (m, 4H), 1.11 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 2.51 (s, 1H), 3.13 (s, 3H), 3.48 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 3.51-3.57 (m, 4H), 3.67 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.14 (s, 2H), 7.65 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.89 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.97 (s, 1H), 8.10 (s, 1H).
75		—CH_3	—$OCH_2CH_2CH_2CH_3$	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 0.83-1.05 (m, 7H), 1.45-1.51 (m, 4H), 2.29 (s, 3H), 3.37 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.56 (t, 2H, J= 7.0 Hz), 3.78 (s, 3H), 4.99 (s, 2H), 7.58 (d,

					1H, J = 8.0 Hz), 7.96 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.09 (s, 1H).
76	—CH_3	—CH_3	$HC{\equiv}C{-}CH_2O{-}$	—CH_3	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.09 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 3.12 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.57 (s, 1H), 3.74 (s, 3H), 4.32 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 7.54 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.84 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.98 (s, 1H).
77	—H	—CH_3		—CH_3	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.22 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.72 (s, 2H), 5.78 (s, 1H), 7.22 (s, 1H), 7.35 (s,

	1H), 7.55 (s, 1H), 7.61 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.93 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.07 (s, 1H).				
78		—CH_3	—OCH_2CF_3	—CH_3		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 0.83-1.05 (m, 4H), 2.34 (s, 3H), 2.51 (s, 1H), 3.36 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 4.35 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 3.77 (s, 3H), 4.98 (s, 2H), 7.45 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.79 (s, 1H), 7.98 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.06 (s, 1H).
79	—CH_3	—CH_3		—CH_3		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 2.07 (s, 3H), 2.22(s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 3.09 (s,

80	—H	—CH_3	—OCH_2CH_3	—CH_3	
					^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.10 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 1.32 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 2.30 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.58 (q, 2H, J= 7.0 Hz), 3.61 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.32 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 5.14 (s, 2H), 7.61 (s, 1H), 7.65 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.94 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.98 (s, 1H).
					3H), 3.58 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 5.72 (s, 2H), 6.24 (s, 1H), 7.56 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.79 (s, 1H), 7.91 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.02 (s, 1H).

81		—CH_3		—CH_3	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 0.86-1.21 (m, 4H), 1.32 (t, 3H, J= 7.2 Hz), 2.15 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 2.41 (s, 1H), 3.19 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 4.38 (q, 2H, J = 7.2 Hz), 5.86 (s, 2H), 6.42 (s, 1H), 7.64 (d, 1H, J= 7.8 Hz), 7.78 (s, 1H), 7.89 (d, 1H, J= 7.8 Hz), 7.98 (s, 1H).
82	—CH_3	—CH_2CH_3		—CH_3	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.19 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 1.35 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 2.28 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.68 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 3.76 (s,

					3H), 4.37 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 5.69 (s, 2H), 7.29 (s, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.60 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.00 (s, 1H).
83	—H	—CH_2CH_3	—$OCH_2CH_2CH_2OCH_3$	—CH_3	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 300 MHz): δ 1.09 (m, 2H), 1.18 (t, 3H, J = 7.2 Hz), 2.26 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 3.17 (s, 3H), 3.56–3.69 (m, 7H), 3.74 (q, 2H, J = 7.2 Hz), 3.84 (s, 3H), 4.91 (s, 2H), 7.52 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.70 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.96 (s, 1H), 8.10 (s, 1H).

84		$-CH_2CH_3$		$-CH_3$		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 0.83-1.11 (m, 4H), 1.20 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 2.22 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.49 (s, 1H), 3.23 (s, 3H), 3.70-3.76 (m, 5H), 5.78 (s, 2H), 7.22 (s, 1H), 7.35 (s, 1H), 7.61 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.93 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 8.07 (s, 1H).
85	$-CH_3$	$-CH_2CH_3$	$-OCH_2CF_2CHF_2$	$-CH_3$		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.19 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 2.24 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 3.78 (q, 2H, J= 7.0 Hz), 3.96 (t, 2H, J_{HF} = 15 Hz), 5.04 (s, 2H),

					5.89-6.11 (m, 1H), 7.63 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.01 (s, 1H), 8.10 (s, 1H).
86		—CH_2CH_3	—$OCH_2CH_2OCH_2CH_3$	—CH_3	 ^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 0.83-1.11 (m, 4H), 1.10-1.18 (m, 6H), 1.32 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 2.31 (s, 3H), 2.44 (s, 1H), 3.23 (s, 3H), 3.42 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 3.51-3.57 (m, 4H), 3.71 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 3.78 (s, 3H), 4.32 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 5.04 (s, 2H), 7.65 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.89 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.99 (s, 1H).

87	—H	—CH_2CH_3		—CH_3		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.16 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 2.01(s, 3H), 2.27 (s, 3H), 2.49 (s, 1H), 3.23 (s, 3H), 3.68 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 3.76 (s, 3H), 5.69 (s, 2H), 7.29 (s, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.60 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.68 (s, 1H), 7.97 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.08 (s, 1H).
88	—H	—CH_2CH_3		—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.18 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 1.95 (s, 3H), 3.27 (s, 3H), 3.72-3.79 (m, 5H), 3.92 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 5.28(s, 1H), 5.31

					(s, 1H), 7.49 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.68 (s, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.89 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.08 (s, 1H).
89	—CH_3	—CH_2CH_3		—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.20 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 2.08 (s, 3H), 2,34 (s, 3H), 3.36 (s, 3H), 3.70–3.75 (m, 5H), 5.75 (s, 2H), 6.26 (s, 1H), 7.25 (s, 1H), 7.56 (s, 1H), 7.59 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.91 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.02 (s, 1H).
90		—CH_2CH_3	—OCH_2CHF_2	—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 0.85–0.99 (m, 4H), 1.18 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 2.23

91		—CH_2CH_3		—Cl	
					(s, 3H), 2.52 (s, 1H), 3.19 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 3.74 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 3.85–3.90 (td, 2H, J = 3.5 Hz, J_{HF} = 15.5 Hz), 5.04 (s, 2H), 6.11–6.33 (tt, 1H, J = 3.5 Hz, J_{HF} = 55 Hz), 7.63 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.10 (s, 1H).
					^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 0.92–1.19 (m, 4H), 1.19 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 1.99 (s, 3H), 2.45 (s, 1H), 3.28 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 3.75 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 5.76 (s, 2H), 7.26 (s, 1H), 7.44 (s,

					1H), 7.58 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.71 (s, 1H), 7.92 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.06 (s, 1H).
92	—CH_3	—OCH_3	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.20 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 1.30 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 2.23 (s, 3H), 3.29 (s, 3H), 3.61 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 3.76 (q, 2H, J= 7.0 Hz), 4.24 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 4.98 (s, 2H), 7.65 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.94 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.98 (s, 1H).
93	—H	—CH_2CH_3	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.18 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 1.30 (t, 3H, J= 7.0 Hz),

94	—CH_2CH_3	—CH_2CH_3	—OCH_2CHF_2	—Cl	
					^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.05 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 1.18 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 2.23 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.48 (q, 2H, J= 7.0 Hz), 3.69 (s, 3H), 3.74 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 3.85–3.90 (td, 2H, J = 3.5 Hz, J_{HF} = 15.5 Hz), 5.04 (s, 2H),
					2.24 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 3.29 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 3.74 (q, 2H, J= 7.0 Hz), 4.30 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 5.76 (s, 2H), 6.24 (s, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.78 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.96 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 8.01 (s, 1H).

95	—CH_2CH_3	—CH_2CH_3		—Cl	
					^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.02 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 1.19 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 2.07 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 3.18 (s, 3H), 3.30 (s, 3H), 3.49 (q, 2H, J= 7.0 Hz), 3.62 (s, 3H), 3.78 (q, 2H, J= 7.0 Hz), 4.99 (s, 2H), 7.45 (s, 1H). 7.63 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 8.10 (s, 1H).
					6.11-6.33 (tt, 1H, J = 3.5 Hz, J_{HF} = 55 Hz), 7.63 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 8.10 (s, 1H).

96			—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 0.87-1.05 (m, 4H), 1.17-1.28 (m, 9H), 2.28 (q, 2H, J= 7.0 Hz), 2.52 (s, 1H), 3.35 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.54-3.64 (m, 1H), 3.72 (s, 3H), 5.01 (s, 2H), 7.45 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.99 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 8.08 (s, 1H).
97	—H		—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.17 (d, 6H, J= 7.0 Hz), 2.00 (s, 3H), 3.08 (s, 3H), 3.54-3.68 (m, 4H), 3.74 (s, 3H), 5.76 (s, 2H), 7.26 (s, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.58 (d, 1H, J= 8.0

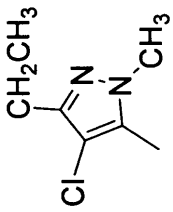
						Hz), 7.92 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.04 (s, 1H).
98	—CH_3		—OCH_2CF_3	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.21 (d, 6H, J= 7.0 Hz), 2.16 (s, 3H), 3.34 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.54–3.62 (m, 1H), 3.78 (s, 3H), 4.22 (q, 2H, J_{HF} = 9.0 Hz), 4.96 (s, 2H), 7.42 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.02 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.11 (s, 1H).
99	—CH_2CH_3			—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.09 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 1.28 (d, 6H, J= 7.0 Hz), 2.22 (s, 3H), 2.49 (q, 2H, J= 7.0 Hz), 3.30 (s, 3H), 3.50–3.68 (m, 4H),

					4.99 (s, 2H), 6.24 (s, 1H). 7.45 (s, 1H). 7.63 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 8.02 (s, 1H), 8.10 (s, 1H).
100	—H			—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.25 (d, 6H, J= 7.0 Hz), 3.12 (s, 3H), 3.50-3.68 (m, 5H), 3.74 (s, 3H), 4.32 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 7.54 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.71 (s, 1H), 7.84 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.98 (s, 1H).
101	—CH_3			—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.21 (d, 6H, J = 7.0 Hz), 1.70-1.90 (m, 4H), 2.16 (s, 3H), 3.34

102	—H	—CH_3	—OCH_2CHF_2	—Cl		^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 3.09 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.85–3.90 (td, 2H, J = 3.5 Hz, J_{HF} = 15.5 Hz), 5.04 (s, 2H), 6.11–6.33 (tt, 1H, J = 3.5 Hz, J_{HF} = 55 Hz), 7.40 (s, 1H), 7.63 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.92 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.00 (s, 1H).
						(s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.54–3.62 (m, 1H), 3.78 (s, 3H), 3.82–3.94 (m, 2H), 4.26 (s, 2H), 4.68–4.76 (m, 1H), 4.96 (s, 2H), 7.42 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.02 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.10 (s, 1H).

103	$-CH_3$			$-Cl$	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.21 (d, 6H, J= 7.0 Hz), 2.07 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 3.09 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.59-3.68(m, 1H), 5.72 (s, 2H), 6.24 (s, 1H), 7.56 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 7.91 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 8.05 (s, 1H).
104	$-CH_2CH_3$	$-CH_2CH_3$	$-OCH_2CH_3$	$-Cl$	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.10-1.25 (m, 6H), 1.37 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 2.29-2.41 (m, 4H), 3.12 (q, 2H, J= 7.0 Hz), 3.32 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 4.89 (s, 2H), 7.62 (d,

					1H, J= 8.0 Hz), 7.99 (d, 1H, J= 8.0 Hz), 8.11 (s, 1H),.
105	—H	—CH_3	—OCH_2CF_3	—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.25 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 2.35 (q, 2H, J= 7.0 Hz), 3.34 (s, 3H), 3.48 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.22 (q, 2H, J_{HF} = 9.0 Hz), 4.86 (s, 2H), 7.42 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.71 (s, 1H), 8.02 (d, 1H, J = 8.0 Hz).
106	—CH_3	H_3C—CH(CH_3)		—Cl	^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.20 (t, 3H, J= 7.0 Hz), 1.48 (d, 6H, J= 7.0 Hz), 2.29 (q, 2H, J= 7.0 Hz), 3.34 (s, 3H), 3.48 (s, 3H), 3.53–3.62 (m, 1H),

107	—CH_2CH_3	$HC{\equiv}C{-}CH_2O{-}$	—CH_2CH_3	—Cl	
					^{1}H NMR (DMSO-d_6, 500 MHz): δ 1.05-1.20 (m, 6H), 1.32 (t, 3H, J = 7.0 Hz), 2.31-2.46 (m, 4H), 3.19 (q, 2H, J = 7.0 Hz), 3.42 (s, 3H), 3.60 (s, 1H), 3.68 (s, 3H), 4.36 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 7.62 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.99 (d, 1H, J = 8.0 Hz).
					3.78 (s, 3H), 4.86 (s, 2H), 6.26 (s, 1H), 7.25 (s, 1H), 7.59 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 7.91 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 8.02 (s, 1H).

【００５１】

本発明を実施するための特定の形態

本発明の内容は、以下の実施態様でさらに説明される。当業者においては、本発明の主題が、以下の実施例によって制限されていると解釈するべきではなく；本発明の内容に基

づいて達成された任意の技術も、本発明の範囲内に含まれるものとする。実施態様の技術的パラメーターおよび生産収量は訂正することなく示される。

【００５２】

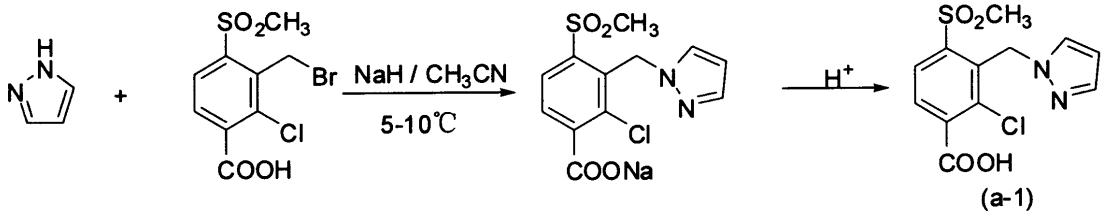
実施態様1

本実施態様は、表１の化合物０１を調製する方法を詳説するものである。化合物０１は、次の反応経路を通じて合成することができる。

【００５３】

工程１：中間体（ａ１）の合成

【化１１】

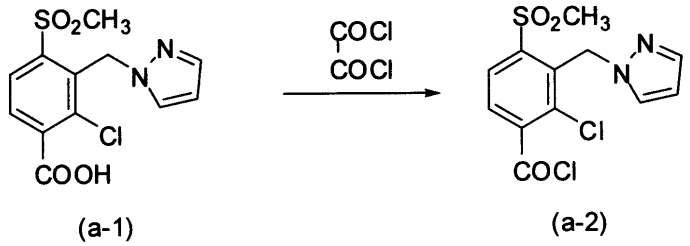


アセトニトリルを５０ｍｌ計量し、２５０ｍｌの三口フラスコに添加した。フラスコを氷水浴に置き、温度を５～１０℃で管理した。６０％（質量分率）ＮａＨを３．０ｇ（０．０７５ｍｏｌ）計量し、三口フラスコにゆっくりと添加した。温度を１０℃以下で管理した。その後、ピラゾール２．４ｇ（０．０３６ｍｏｌ）を小量のアセトニトリル中に溶解させ、得られた溶液を、滴下漏斗に入れ、温度を約０℃に低下させた際に、反応システム中に投入した。投入後、混合物を氷水浴条件下で撹拌し続けた。システムの温度が安定した際に、２－クロロ－３－ブロモメチル－４－メチルスルホニル安息香酸を１０ｇ（０．０３３ｍｏｌ）計量し、１０℃以下に管理された温度で、バッチでゆっくりと添加した。添加後、システムを氷水浴中で連続的に撹拌した。原料が完全に消費されるまで、反応をＨＰＬＣで追跡した。回転式蒸発を通じてアセトニトリルを除去し、残渣に水２００ｍｌを添加し、その後ＨＣｌを一滴ずつ添加し、室温で撹拌し、固形粒子を沈殿させた。オフホワイト色固体、即ち、中間体（ａ１）を吸引濾過で回収し、その後使用のために乾燥炉に入れた。

【００５４】

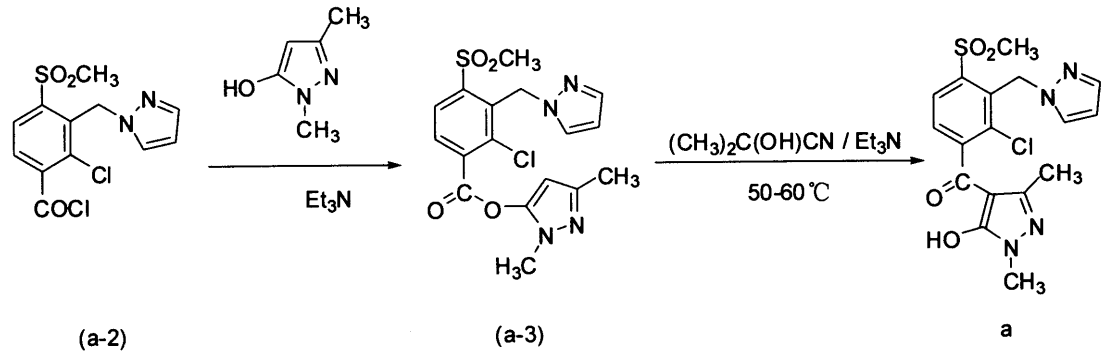
工程２：中間体（ａ２）の合成

【化１２】



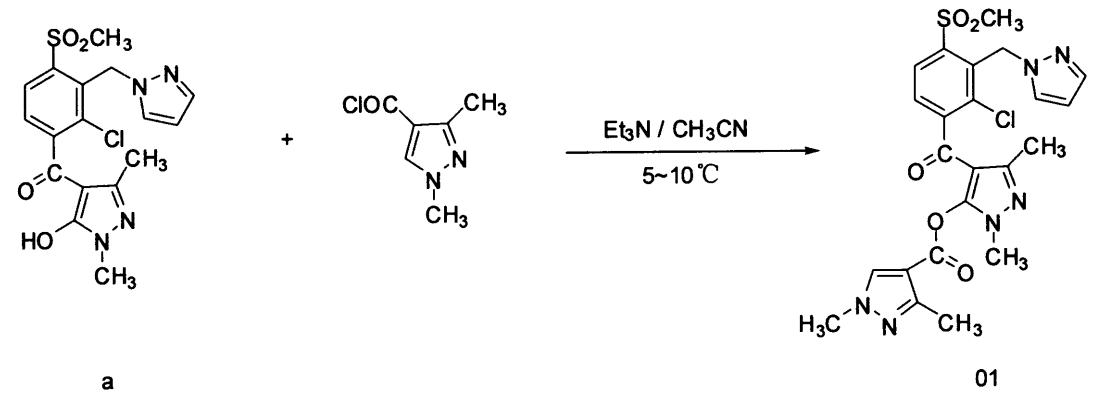
中間体（ａ１）を１０ｇ（０．０３０ｍｏｌ）計量し、２５０ｍｌのフラスコに添加し、続けて５０ｍｌのジクロロエタンに添加した。触媒としてＤＭＦを数滴、得られた混合物に添加した。その後、塩化オキサリル５ｇ（０．０３９ｍｏｌ）を小量のジクロロエタン中に溶解させ、得られた溶液を、滴下漏斗に入れ、室温で反応システム中に投入した。添加後、反応システムを室温で約２時間撹拌し続け、中間体（ａ２）を含有する反応溶液を得た。反応溶液は、一切の処理なく、次の反応に使用することができた。

【００５５】
工程３：中間体ａの合成
【化１３】



１，３－ジメチル－５－ピラゾル－オールを１．７ｇ（０．０１５ｍｏｌ）計量し、２５０ｍｌの三口フラスコに添加した。１，２－ジクロロエタン５０ｍｌを加えて溶解させた。トリエチルアミンを４．０ｇ（０．０４０ｍｏｌ）計量し、反応システムに添加した。中間体（ａ２）（中間体（ａ２）を０．０１０ｍｏｌ含有）の１，２－ジクロロエタン溶液を、氷水浴およびアルゴン保護の条件下で反応システム中に投入した。１時間後、反応をＨＰＬＣで追跡した。原料が完全に消費された後、中間体（ａ３）を含有する反応溶液を得た。トリエチルアミン１．０ｇ（０．０１０ｍｏｌ）およびアセトンシアノヒドリン数滴を、アルゴン保護下で５０～６０℃の管理した温度にて中間体（ａ３）を含有する反応溶液に添加した。２時間反応を行った後、反応をＨＰＬＣで追跡した。反応が完了した際に水１００ｍｌを添加し、次に、ｐＨが約３に調節されるまで、室温で撹拌しながらＨＣｌで投入した。得られた水層を抽出によって除去した。得られた有機層を、２００ｍｌの水で２回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、回転式蒸発によって濃縮して化合物ａとして淡褐色粉末固体を３．６ｇ得た。

【００５６】
工程４：化合物０１の合成
【化１４】



化合物を２．１ｇ（０．００５ｍｏｌ）計量し、１００ｍｌのフラスコに添加した。アセトニトリル１５ｍｌおよびトリエチルアミン１．０ｇ（０．０１０ｍｏｌ）を添加し、得られた混合物を氷水浴条件下で撹拌した。１，３－ジメチルピラゾール－４－ホルミルクロリドを１．０ｇ（０．００６ｍｏｌ）計量し、１０ｍｌのアセトニトリル中に溶解させた。溶液を滴下漏斗に入れ、氷水浴条件下で投入した。化合物ａが完全に消費されるまで反応をＨＰＬＣで追跡した。反応が完了した際に、水１００ｍｌおよび酢酸エチル１００ｍｌを反応システムに添加した。得られた水層を抽出によって除去した。得られた有機層を１００ｍｌの飽和食塩水で２回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、回転式蒸発

によって濃縮して淡褐色固体を得た。１．５ｇの淡黄色粉末固体、即ち化合物０１はカラムクロマトグラフィー精製後に得た。ＨＰＬＣによって決定された含有量は９３．９％であり、収率は５３．１％であった。

【００５７】

^{1}Ｈ　ＮＭＲデータ：表１を参照のこと。

【００５８】

実施態様２～１３では、表１のそれぞれ化合物０２～化合物１３の合成物を得、その合成方法は実施態様１と類似していたため、ここではそれらの説明を記載しない。

【００５９】

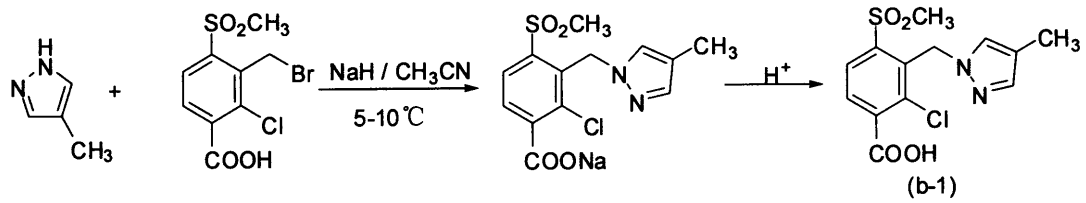
実施態様１４

本実施態様は、表１の化合物１４の合成を詳説するものである。化合物１４は次の反応経路を通じて合成することができる。

【００６０】

工程１：中間体（ｂ－１）の合成

【化１５】

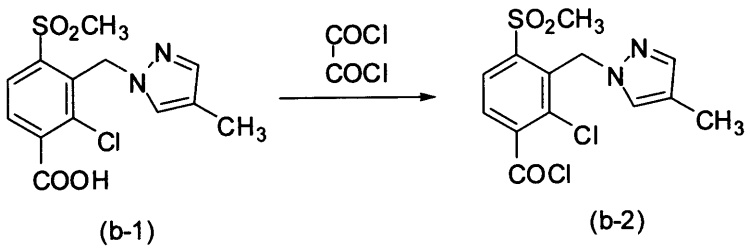


アセトニトリルを５０ｍｌ計量し、２５０ｍｌの三口フラスコに添加した。フラスコを氷水浴に入れ、温度を５～１０℃で管理した。ＮａＨを３．０ｇ（０．０７５ｍｏｌ）計量し、１０℃以下に管理された温度で三口フラスコにゆっくり添加した。４－メチルピラゾールを３ｇ（０．０３６ｍｏｌ）計量し、次に、小量のアセトニトリル中に溶解させた。溶液を滴下漏斗に入れ、温度が約０℃に低下した際に、反応システムに一滴ずつ添加した。投入後、システムを氷水浴条件下で撹拌し続けた。温度が安定した際に、２－クロロ－３－ブロモメチル－４－メチルスルホニル安息香酸を１０ｇ（０．０３３ｍｏｌ）計量し、撹拌しながら氷水浴条件下で１０℃以下に管理された温度にてバッチで反応システムに添加した。原料が完全に消費されるまで、反応をＨＰＬＣで追跡した。アセトニトリルを回転式蒸発によって除去し、残渣に水２００ｍｌを添加し、次にＨＣｌを一滴ずつゆっくりと添加し、室温で撹拌して固形粒子を沈殿させた。粒子を吸引濾過によって回収してオフホワイト固体、即ち中間体（ｂ－１）を得た。中間体をさらなる使用のために乾燥炉に入れた。

【００６１】

工程２：中間体（ｂ－２）の合成

【化１６】



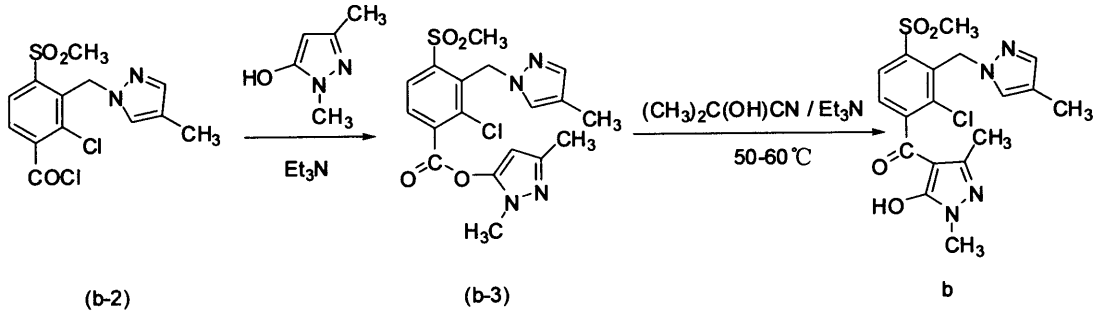
中間体（ｂ－１）を１０ｇ（０．０３０ｍｏｌ）計量し、２５０ｍｌのフラスコに添加した。ジクロロエタン５０ｍｌを添加し、小量のＤＭＦを触媒として溶液に投入した。そ

の後、塩化オキサリルを５ｇ（０．０３９ｍｏｌ）計量し、小量のジクロロエタン中に溶解させた。得られた溶液を滴下漏斗に入れ、室温でシステムに投入した。投入後、反応システムを室温で約２時間撹拌し続け、中間体（ｂ－２）を含有する反応溶液を得た。反応溶液は、一切の処理なく次の反応に直接使用することができた。

【００６２】

工程３：化合物ｂの合成

【化１７】

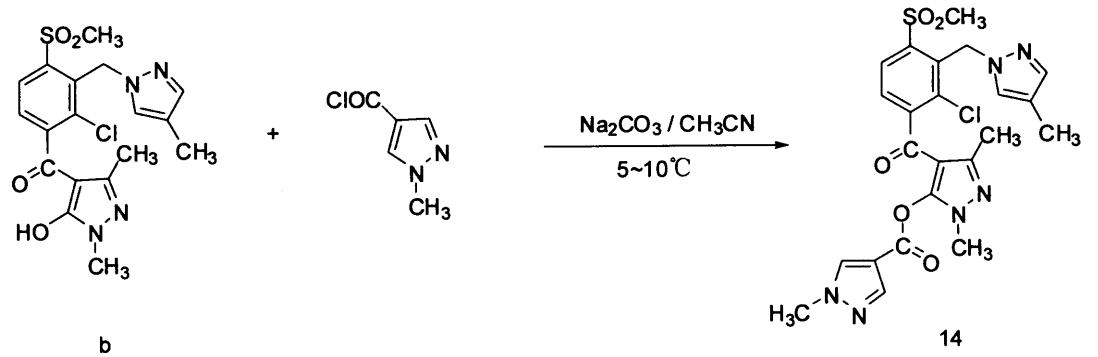


１，３－ジメチル－５－ピラゾル－オールを４．０ｇ（０．０３６ｍｏｌ）計量し、２５０ｍｌの三口フラスコに添加した。１，２－ジクロロエタン５０ｍｌを添加し、溶解させた。トリエチルアミンを１２ｇ（０．１２ｍｏｌ）計量し、システムに入れた。氷水浴およびアルゴン保護の条件下で中間体（ｂ－２）を含有している反応溶液（０．０３０ｍｏｌ）を一滴ずつ添加した。１時間後、反応をＨＰＬＣで追跡し、原料が完全に消費された際に、中間体（ｂ－３）を含有している反応溶液が得られた。トリエチルアミン３．０ｇ（０．０３０ｍｏｌ）およびアセトンシアノヒドリン０．５ｍｌを、アルゴン保護下で５０～６０℃に管理された温度にて中間体（ｂ－３）を含有している反応溶液に添加し、２時間反応させ、反応をＨＰＬＣで追跡した。反応が完了した際に、水１００ｍｌを添加し、続けてＨＣｌを一滴ずつゆっくり添加した。ｐＨが約３に調節されるまで、得られた混合物を室温で撹拌した。水層を抽出によって除去した。有機層を２００ｍｌの水で２回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、回転式蒸発によって濃縮して淡褐色粉末固体、即ち化合物ｂを８．１ｇ得た。

【００６３】

工程４：化合物１４の合成

【化１８】



化合物ｂを２．２ｇ（０．００５ｍｏｌ）計量し、１００ｍｌのフラスコに添加した。アセトニトリル２０ｍｌおよび炭酸ナトリウム１．０ｇ（０．０１０ｍｏｌ）を添加し、氷水浴条件下で撹拌した。１－メチルピラゾール－４－ホルミルクロリドを０．８ｇ（０．００５５ｍｏｌ）計量し、アセトニトリル１０ｍｌ中に溶解させた。得られた溶液を滴

下漏斗に入れ、氷水浴条件下でシステムに投入した。化合物ｂが完全に消費されるまで、反応をＨＰＬＣで追跡した。その後、水１００ｍｌおよび酢酸エチル１００ｍｌを添加した。水層を抽出によって除去した。有機層を１００ｍｌの飽和食塩水で２回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、回転式蒸発によって濃縮して暗褐色グリースを得、これをエタノール中の再結晶化に供して２．０ｇの淡褐色粉末固体、即ち、化合物１４を得た。ＨＰＬＣによって決定された含有量は９４．１％であり、収率は７０．９％であった。

【００６４】

^{1}Ｈ　ＮＭＲデータ：表１を参照のこと。

【００６５】

実施態様１５～２２では、表１のそれぞれ化合物１５～化合物２２の合成物を得、その合成方法は実施態様１４と類似していたため、ここではそれらの説明を記載しない。

【００６６】

実施態様２３

本実施態様は、表１の化合物２３の特定の合成を詳説するものである。化合物２３は次の反応経路を通じて合成することができる。

【００６７】

工程１：中間体（ｂ－１）の合成

実施態様１４を参照のこと。

【００６８】

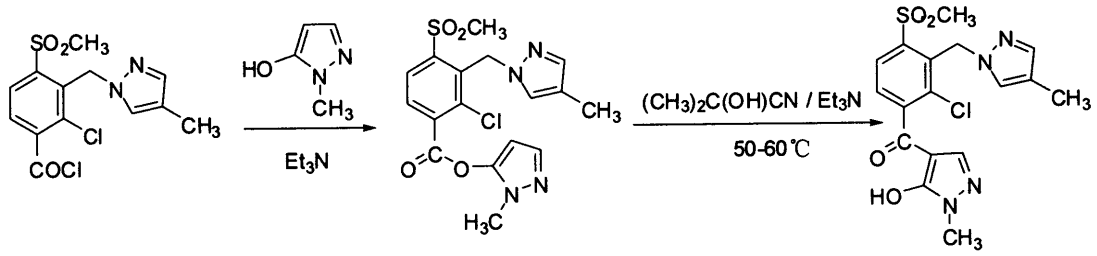
工程２：中間体（ｂ－２）の合成

実施態様１４を参照のこと。

【００６９】

工程３：化合物ｃの合成

【化１９】

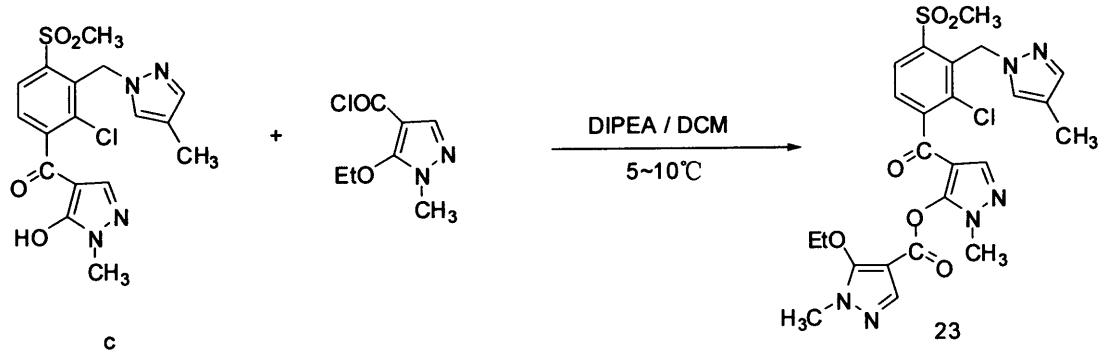


１－メチル－５－ピラゾル－オールを３．６ｇ（０．０３６ｍｏｌ）計量し、２５０ｍｌの三口フラスコに添加した。１，２－ジクロロエタン５０ｍｌを添加し、溶解させた。トリエチルアミン１２ｇ（０．１２ｍｏｌ）を計量し、システムに添加した。中間体（ｂ－２）（０．０３０ｍｏｌ）を含有している反応溶液を、氷水浴およびアルゴン保護の条件下でシステムに添加した。１時間後、反応をＨＰＬＣで追跡した。原料が完全に消費された際に、中間体（ｃ－１）を含有している反応溶液が得られた。トリエチルアミン３．０ｇ（０．０３０ｍｏｌ）およびアセトンシアノヒドリン０．５ｍｌを、アルゴン保護下で５０～６０℃に管理された温度にて中間体（ｃ－１）を含有している反応溶液に添加した。２時間後、反応をＨＰＬＣで追跡した。反応が完了た際に、水１００ｍｌを添加し、続けてｐＨが約３になるまで、室温で撹拌しながらＨＣｌを一滴ずつゆっくり添加した。水層を抽出によって除去した。有機層を２００ｍｌの水で２回で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、回転式蒸発によって濃縮して７．９ｇの淡褐色粉末固体を化合物ｃとして得た。

【００７０】

工程４：化合物２３の合成

【化２０】



c 23

化合物ｃを２．１ｇ（０．００５ｍｏｌ）計量し、１００ｍｌのフラスコに添加し、続けてジクロロメタン２０ｍｌおよびＮ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン１．３ｇ（０．０１０ｍｏｌ）を添加し、得られた混合物を氷水浴条件下で撹拌した。１－メチル－５－エトキシルピラゾール－４－ホルミルクロリドを１．０ｇ（０．００５５ｍｏｌ）計量し、ジクロロメタン１０ｍｌ中に溶解させた。得られた溶液を、滴下漏斗に入れ、氷水浴条件下で反応システム中に投入した。化合物ｃが完全に消費されるまで、反応をＨＰＬＣで追跡した。その後、水１００ｍｌおよびジクロロメタン１００ｍｌを添加した。得られた水層を抽出によって除去した。得られた有機層を、１００ｍｌの飽和食塩水で２回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、回転式蒸発によって濃縮して淡褐色固体を得、これを９５％エタノール中で再結晶化に供して淡黄色粉末固体、即ち化合物２３を１．９ｇ得た。ＨＰＬＣによって決定された含有量は９５．１％であり、収率は６４．４％であった。

【００７１】

^{1}Ｈ　ＮＭＲデータ：表１を参照のこと。

【００７２】

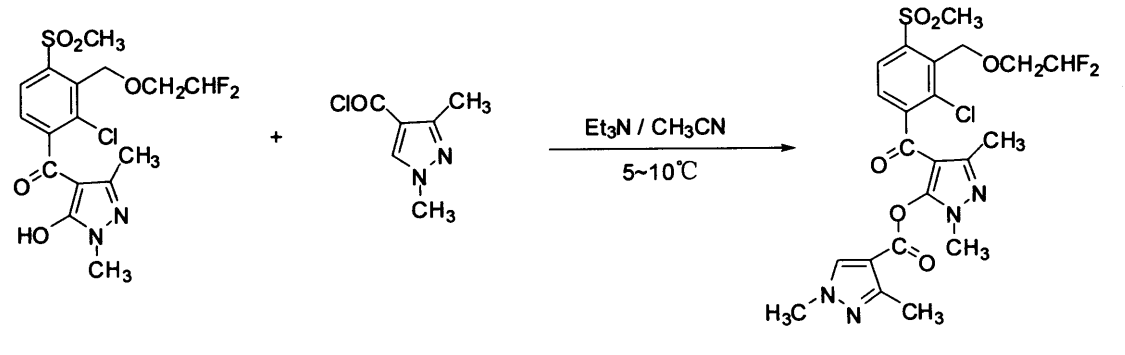
実施態様２４では、表１の化合物２４の合成物を得、その合成方法は実施態様２３と類似していたため、ここではその説明を記載しない。

【００７３】

実施態様２５

本実施態様は、表１の化合物２５の合成を詳説するものである。化合物２５は次の反応経路を通じて合成することができる。

【化２１】



d 25

【００７４】

実験操作：

化合物ｄを２．２ｇ（０．００５ｍｏｌ）計量し、１００ｍｌのフラスコに添加し、続けてアセトニトリル１５ｍｌおよびトリエチルアミン１．０ｇ（０．０１０ｍｏｌ）を添

加し、得られた混合物を氷水浴条件下で撹拌した。１，３－ジメチルピラゾール－４－ホルミルクロリドを１．０ｇ（０．００６ｍｏｌ）計量し、アセトニトリル１０ｍｌ中に溶解させた。溶液を滴下漏斗に入れ、氷水浴条件下で反応システム中に投入した。化合物ｄが完全に消費されるまで、反応をＨＰＬＣで追跡した。その後、水１００ｍｌおよび酢酸エチル１００ｍｌを添加した。得られた水層を抽出によって除去した。有機層を１００ｍｌの飽和食塩水で２回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、回転式蒸発によって濃縮して淡褐色固体を得、これを９５％エタノール中の再結晶化に供して淡黄色粉末固体、即ち化合物２５を１．７ｇ得た。ＨＰＬＣによって決定された含有量は９２．３％であり、収率は５７．６％であった。

【００７５】

^{1}Ｈ　ＮＭＲデータ：表１を参照のこと。

【００７６】

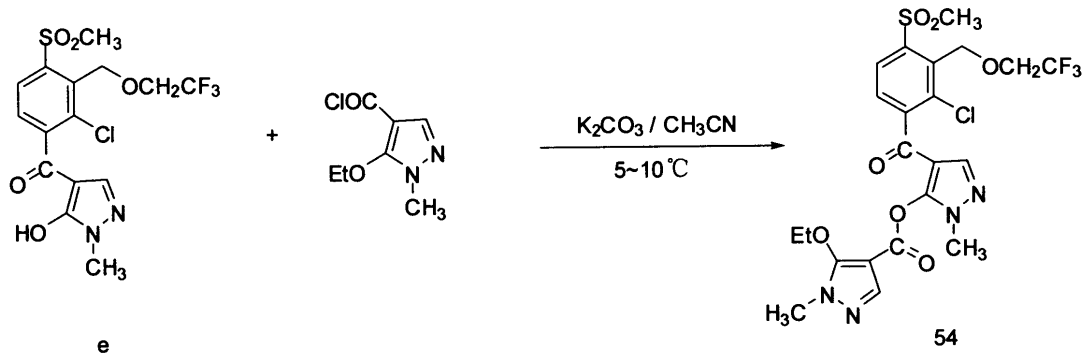
実施態様２６～５３では、表１のそれぞれ化合物２６～化合物５３の合成物を得、その合成方法は実施態様２５と類似していたため、ここではそれらの説明を記載しない。

【００７７】

実施態様５４

本実施態様は、表１の化合物５４の合成を詳説するものである。化合物５４は次の反応経路を通じて合成することができる。

【化２２】



【００７８】

実験操作：

化合物ｅを２．４ｇ（０．００５ｍｏｌ）計量し、１００ｍｌのフラスコに添加し、続けて、アセトニトリル２０ｍｌおよび炭酸カリウム１．４ｇ（０．０１０ｍｏｌ）を添加し、得られた混合物を氷水浴条件下で撹拌した。１－メチル－５－エトキシルピラゾール－４－ホルミルクロリドを１．０ｇ（０．００５５ｍｏｌ）計量し、アセトニトリル１０ｍｌ中に溶解させた。その溶液を滴下漏斗に入れ、氷水浴条件下で反応システム中に投入した。化合物ｅが完全に消費されるまで、反応をＨＰＬＣで追跡した。その後、水１００ｍｌおよび酢酸エチル１００ｍｌを添加した。得られた水層を抽出によって除去した。得られた有機層を１００ｍｌの飽和食塩水で２回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、回転式蒸発によって濃縮して暗褐色固体を得、９５％エタノール中で再結晶化に供して黄色粉末固体、即ち、化合物５４を２．１ｇ得た。ＨＰＬＣによって決定された含有量は９４．３％であり、収率は６８．３％であった。

【００７９】

^{1}Ｈ　ＮＭＲデータ：表１を参照のこと。

【００８０】

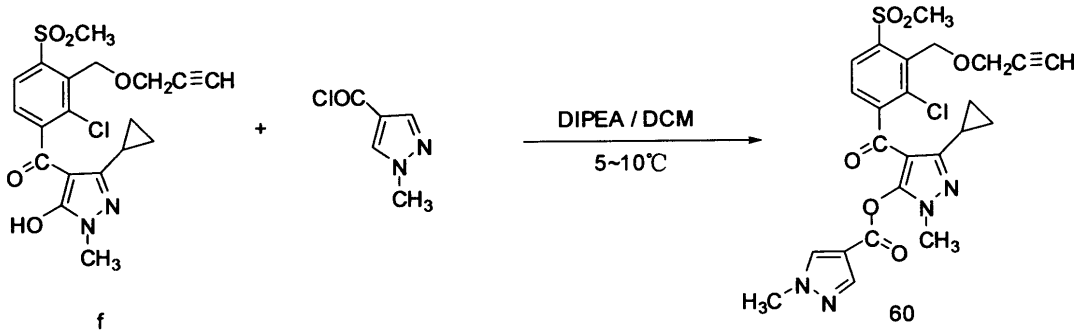
実施態様５５～５９では、表１のそれぞれ化合物５５～化合物５９の合成物を得、その合成方法は実施態様５４と類似していたため、ここではそれらの説明を記載しない。

【００８１】

実施態様６０

本実施態様は、表１の化合物６０の合成を詳説するものである。化合物６０は次の反応経路を通じて合成することができる。

【化２３】



【００８２】

実験操作：

化合物ｆを２．１ｇ（０．００５ｍｏｌ）計量し、１００ｍｌのフラスコに添加し、続けてジクロロメタン２０ｍｌおよびＮ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン１．３ｇ（０．０１０ｍｏｌ）を添加し、得られた混合物を氷水浴条件下で撹拌した。１－メチルピラゾール－４－ホルミルクロリドを０．８ｇ（０．００５５ｍｏｌ）計量し、ジクロロメタン１０ｍｌ中に溶解させた。得られた溶液を滴下漏斗に入れ、氷水浴条件下で反応システム中に投入した。化合物ｆが完全に消費されるまで、反応をＨＰＬＣで追跡した。その後、水１００ｍｌおよびジクロロメタン１００ｍｌを添加した。得られた水層を抽出によって除去した。得られた有機層を１００ｍｌの飽和食塩水で２回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、回転式蒸発によって濃縮して暗褐色固体を得、９５％エタノール中で再結晶化に供して淡褐色粉末、即ち、化合物６０を２．１ｇ得た。ＨＰＬＣによって決定された含有量は９５．７％であり、収率は７６．６％であった。

【００８３】

^{1}Ｈ　ＮＭＲデータ：表１を参照のこと。

【００８４】

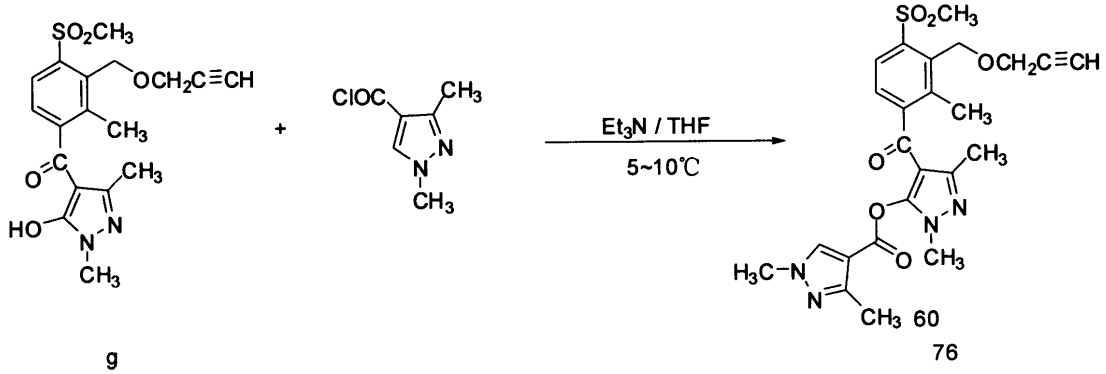
実施態様６１～７５では、表１のそれぞれ化合物６１～化合物７５の合成物を得、その合成方法は実施態様６０と類似していたため、ここではそれらの説明を記載しない。

【００８５】

実施態様７６

本実施態様は、表１の化合物７６の特定の合成を詳説するものである。化合物７６は次の反応経路を通じて合成することができる。

【化２４】



【００８６】

実験操作

化合物ｇを１．９ｇ（０．００５ｍｏｌ）計量し、１００ｍｌのフラスコに添加し、続けてテトラヒドロフラン２０ｍｌおよびトリエチルアミン１．０ｇ（０．０１０ｍｏｌ）を添加し、得られた混合物を氷水浴条件下で撹拌した。、３－ジメチルピラゾール－４－ホルミルクロリドを０．９ｇ１（０．００５５ｍｏｌ）計量し、テトラヒドロフラン１０ｍｌ中に溶解させた。得られた溶液を滴下漏斗に入れ、氷水浴条件下で反応システム中に投入した。化合物ｇが完全に消費されるまで、反応をＨＰＬＣで追跡した。その後、水１００ｍｌおよび１００ｍｌの酢酸エチルは加えられた。得られた水層を抽出によって除去した。得られた有機層を１００ｍｌの飽和食塩水で２回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、回転式蒸発によって濃縮して褐色固体を得、これを９５％エタノール中で再結晶化に供して淡褐色粉末固体、即ち、化合物７６を１．８ｇ得た。ＨＰＬＣによって決定された含有量は９６．２％であり、収率は６９．４％であった。

【００８７】

^{1}Ｈ　ＮＭＲデータ：表１を参照のこと。

【００８８】

実施態様７７～８１では、表１のそれぞれ化合物７７～化合物８１の合成物を得、その合成方法は実施態様７６と類似していたため、ここではそれらの説明を記載しない。

【００８９】

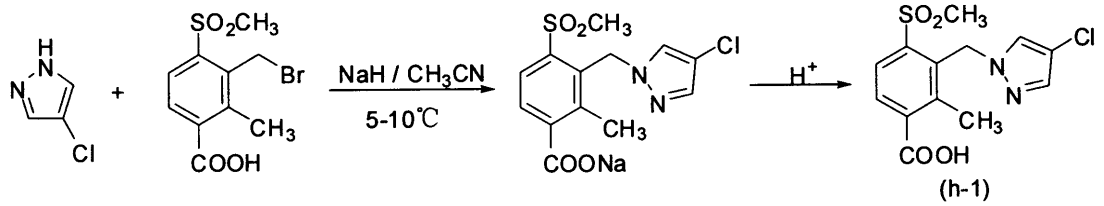
実施態様８２

本実施態様は、表１の化合物８２の特定の合成を詳説するものである。化合物８２は次の反応経路を通じて合成することができる。

【００９０】

工程１：中間体（ｈ－１）の合成

【化２５】



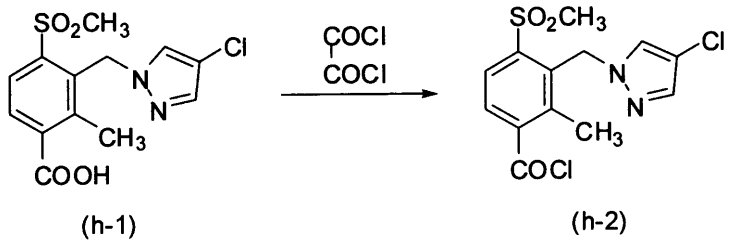
【００９１】

アセトニトリルを５０ｍｌ計量し、２５０ｍｌの三口フラスコに添加した。フラスコを５～１０℃に管理された温度で氷水浴に置いた。ＮａＨを４．４ｇ（０．１１ｍｏｌ）計量し、１０℃以下に管理された温度でフラスコにゆっくり添加した。その後４．６ｇ（０．０４５ｍｏｌ）の４－クロロピラゾールを小量のアセトニトリル中に溶解させ、得られた溶液を滴下漏斗に入れ、反応システムの温度が約０℃に低下した際に反応システム中に一滴ずつ添加した。投入後、反応システムを氷水浴条件下で撹拌し続けた。システムの温度が安定した際に、２－メチル－３－ブロモメチル－４－メチルスルホニル安息香酸を１０ｇ（０．０３４ｍｏｌ）計量し、氷水浴条件下で１０℃以下に管理された温度にてバッチで反応システム中にゆっくり添加した。材料が完全に消費されるまで、反応をＨＰＬＣで追跡した。アセトニトリルを回転式蒸発を通じて除去した。水２００ｍｌを得られた残渣に添加し、続けて、室温で撹拌しながらＨＣｌを一滴ずつゆっくりと添加して粒子を沈殿させた。オフホワイト色固体、即ち、中間体（ｈ－１）を吸引濾過によって得た。中間体はさらなる使用のために乾燥炉に入れた。

【００９２】

工程２：中間体（ｈ－２）の合成

【化２６】



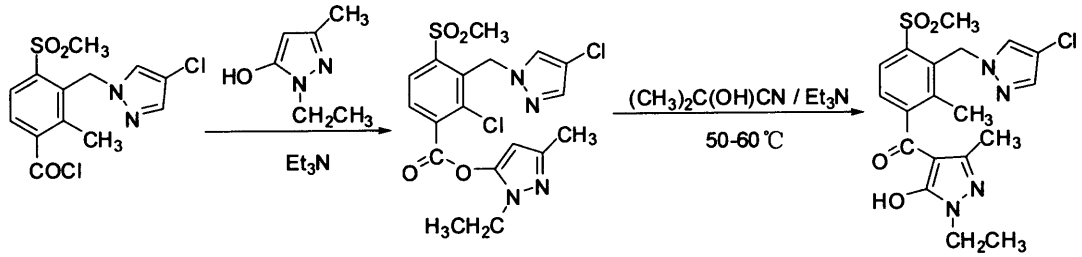
(h-1) (h-2)

中間体（ｈ－１）を１０．５ｇ（０．０３０ｍｏｌ）計量し、２５０ｍｌのフラスコに添加し、続けてジクロロエタン５０ｍｌを添加し、触媒としてＤＭＦを数滴添加した。その後、５ｇ（０．０３９ｍｏｌ）の塩化オキサリルを小量のジクロロエタン中に溶解させ、得られた溶液を滴下漏斗に入れ、室温で反応システム中に投入した。投入後、反応システムを室温で約２時間撹拌し続けて中間体（ｈ－２）を含有している反応溶液を得た。反応溶液は一切の処理なく次の反応に直接使用することができた。

【００９３】

工程３：化合物ｈの合成

【化２７】



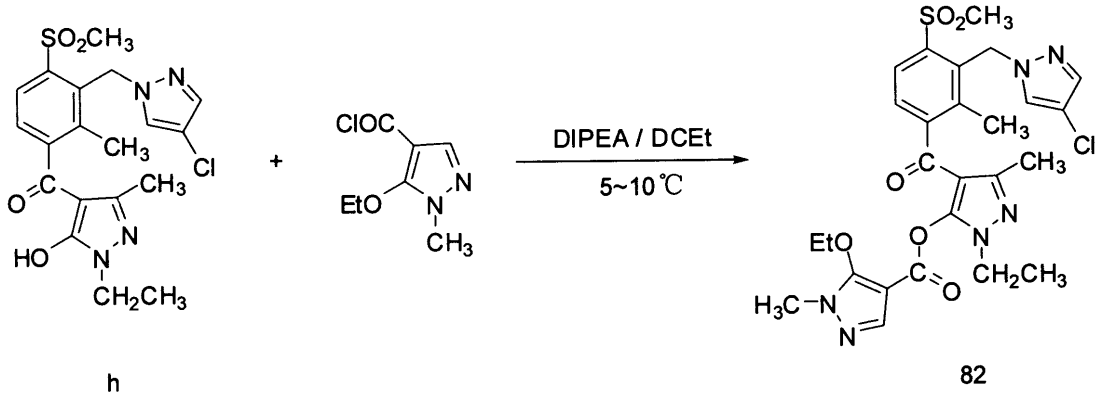
(h-2) (h-3) h

１－エチル－３－メチル－５－ピラゾル－オールを４．５ｇ（０．０３６ｍｏｌ）計量し、２５０ｍｌの三口フラスコに添加した。１，２－ジクロロエタン５０ｍｌを添加して溶解させた。トリエチルアミンを１２ｇ（０．０１２ｍｏｌ）計量し、システム中に添加した。氷水浴条件下で中間体（ｈ－２）を含有している反応溶液（０．０３０ｍｏｌ）をアルゴン保護下でシステムに投入した。１時間後、反応をＨＰＬＣで追跡した。原料が完全に消費された時に中間体（ｈ－３）を含有している反応溶液を得た。トリエチルアミン３．０ｇ（０．０３０ｍｏｌ）およびアセトンシアノヒドリン０．５ｍｌを、アルゴン保護下で４０～５０℃に管理された温度にて中間体（ｈ－３）を含有している反応溶液中に添加した。２時間後、反応をＨＰＬＣで追跡した。反応が完了した際に水１００ｍｌを添加し、続けてｐＨが約３に調節されるまで、室温で撹拌しながらＨＣｌを一滴ずつゆっくり添加した。得られた水層を抽出によって除去した。得られた有機層を２００ｍｌの水で２回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、回転式蒸発によって濃縮して暗褐色粉末固体、即ち、化合物ｈを６．７ｇ得た。

【００９４】

工程４：化合物８２の合成

【化２８】



h

化合物hを2.2g(0.005mol)計量し、100mlのフラスコに添加し、続けて1，2-ジクロロエタン20mlおよびN,N-ジイソプロピルエチルアミン1.3g(0.010mol)を添加し、氷水浴条件下で撹拌した。1-メチル-5-エトキシルピラゾール-4-ホルミルクロリドを1.0g(0.0055mol)計量し、1,2-ジクロロエタン10ml中に溶解させた。得られた溶液を滴下漏斗に入れ、氷水浴条件下で反応システム中に投入した。化合物hが完全に消費されるまで、反応をHPLCで追跡した。その後、水100mlおよびジクロロメタン100mlを添加した。得られた水層を抽出によって除去した。得られた有機層を100mlの飽和食塩水で2回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、回転式蒸発によって濃縮して淡褐色固体を得、これを95%エタノール中で再結晶化に供して黄色粉末固体、即ち、化合物82を1.9g得た。HPLCによって決定された含有量は93.8%であり、収率は62.0%であった。

【００９５】

^{1}H NMRデータ：表1を参照のこと。

【００９６】

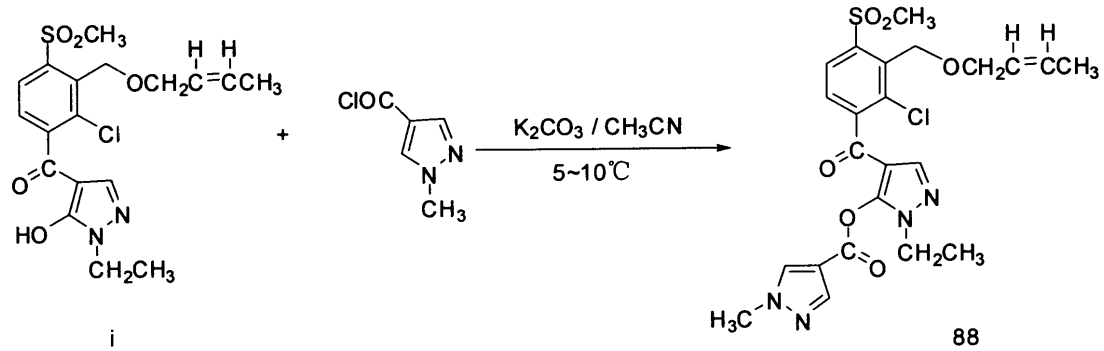
実施態様８３～８７では、表１のそれぞれ化合物８３～化合物８７の合成物を得、その合成方法は実施態様８２と類似していたため、ここではそれらの説明を記載しない。

【００９７】

実施態様８８

本実施態様は、表１の化合物８８の合成を詳説するものである。化合物８８は次の反応経路を通じて合成することができる。

【化２９】



i

【００９８】

実験操作

化合物ｉを２．１ｇ（０．００５ｍｏｌ）計量し、１００ｍｌのフラスコに添加し、続けてアセトニトリル２０ｍｌおよび炭酸カリウム１．４ｇ（０．０１０ｍｏｌ）を添加し

た。得られた混合物を氷水浴条件で撹拌した。１－メチルピラゾール－４－ホルミルクロリドを０．８ｇ（０．００５５ｍｏｌ）計量し、アセトニトリル１０ｍｌ中に溶解させた。得られた溶液を滴下漏斗に入れ、氷水浴条件下で反応システム中に投入した。混合物ｉが完全に消費されるまで反応をＨＰＬＣで追跡した。その後、水１００ｍｌおよび酢酸エチル１００ｍｌを添加した。得られた水層を抽出によって除去した。得られた有機層を１００ｍｌの飽和食塩水で２回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、回転式蒸発によって濃縮して暗褐色固体を得、これを９５％エタノール中で再結晶化に供して褐色粉末固体、即ち、化合物８８を１．６ｇ得た。ＨＰＬＣによって決定された含有量は９０．６％であり、収率は５７．２％であった。

【００９９】

^{1}Ｈ　ＮＭＲデータ：表１を参照のこと。

【０１００】

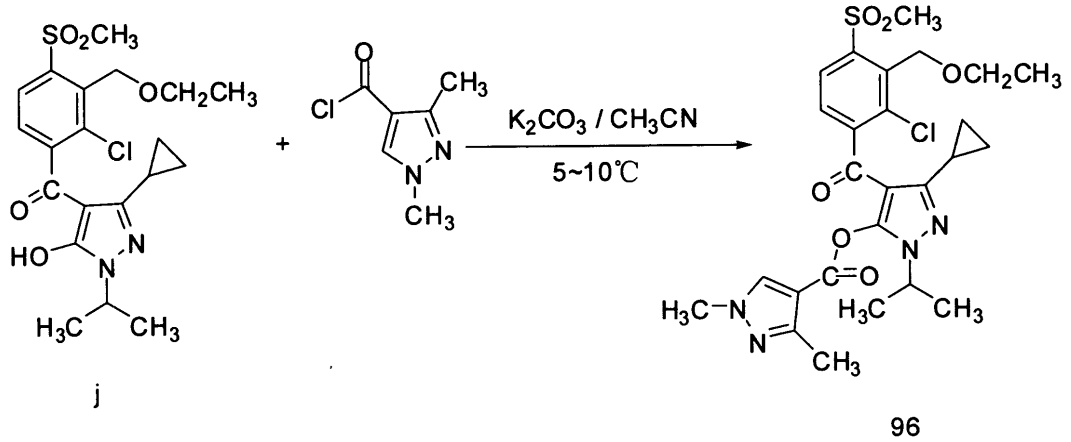
実施態様８５～９５では、表１のそれぞれ化合物８５～化合物９５の合成物を得、その合成方法は実施態様８８と類似していたため、ここではそれらの説明を記載しない。

【０１０１】

実施態様９６

本実施態様は、表１の化合物９６の特定の合成を詳説するものである。化合物９６は次の反応経路を通じて合成することができる。

【化３０】



【０１０２】

実験操作

化合物ｊを２．２ｇ（０．００５ｍｏｌ）計量し、１００ｍｌのフラスコに添加し、続けてアセトニトリル２０ｍｌおよび炭酸カリウム１．４ｇ（０．０１０ｍｏｌ）を添加した。得られた混合物を氷水浴条件下で撹拌した。１，３－ジメチルピラゾール－４－ホルミルクロリドを０．９５ｇ（０．００６ｍｏｌ）計量し、アセトニトリル１０ｍｌ中に溶解させた。得られた溶液を滴下漏斗に入れ、氷水浴条件下で反応システム中に投入した。化合物ｊが完全に消費されるまで、反応をＨＰＬＣで追跡した。その後、水１００ｍｌおよび酢酸エチル１００ｍｌを添加した。得られた水層を抽出によって除去した。得られた有機層を１００ｍｌの飽和食塩水で２回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、回転式蒸発によって濃縮して暗褐色固体を得、これを９５％エタノール中で再結晶化に供して褐色粉末固体、即ち、化合物９６を１．６ｇ得た。ＨＰＬＣによって決定された含有量は９４．７％であり、収率は５３．８％であった。

【０１０３】

^{1}Ｈ　ＮＭＲデータ：表１を参照のこと。

【０１０４】

実施態様９７～１０１では、表１のそれぞれ化合物９７～化合物１０１の合成物を得、

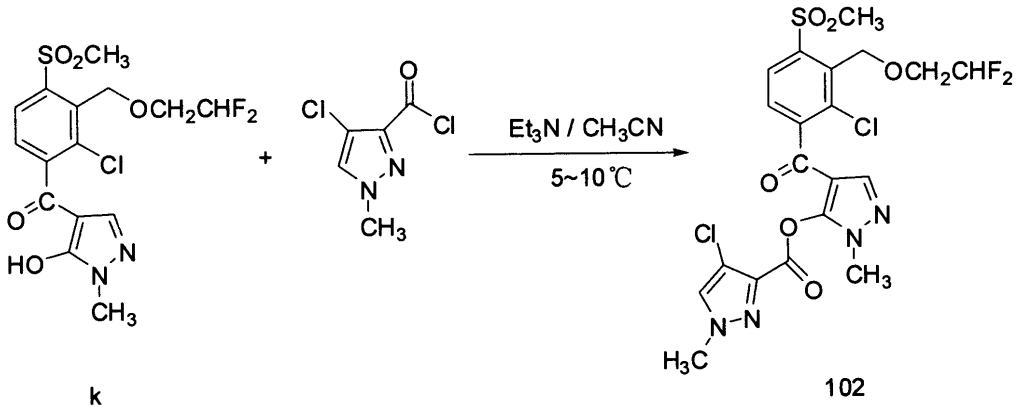
その合成方法は実施態様９６と類似していたため、ここではそれらの説明を記載しない。

【０１０５】

実施態様１０２

本実施態様は、表１の化合物１０２の特定の合成を詳説するものである。化合物１０２は次の反応経路を通じて合成することができる。

【化３１】



k 102

【０１０６】

実験操作

化合物ｋを２．０ｇ（０．００５ｍｏｌ）計量し、１００ｍｌのフラスコに添加し、続けてアセトニトリル２０ｍｌおよびトリエチルアミン１．０ｇ（０．０１０ｍｏｌ）を添加した。得られた混合物を氷水浴条件下で撹拌した。１－メチル－４－クロロピラゾール－３－ホルミルクロリドを１．０ｇ（０．００５５ｍｏｌ）計量し、アセトニトリル１０ｍｌ中に溶解させた。得られた溶液を滴下漏斗に入れ、氷水浴条件下で反応システム中に投入した。化合物ｋが完全に消費されるまで、反応をＨＰＬＣで追跡した。その後、水１００ｍｌおよび酢酸エチル１００ｍｌ添加した。得られた水層を抽出によって除去した。得られた有機層を１００ｍｌの飽和食塩水で２回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、に回転式蒸発によって濃縮して褐色固体を得、これを９５％エタノール中で再結晶化に供して淡褐色粉末、即ち、化合物１０２を１．８ｇ得た。ＨＰＬＣによって決定された含有量は９６．２％であり、収率は６２．８％であった。

【０１０７】

^{1}Ｈ　ＮＭＲデータ：表１を参照のこと。

【０１０８】

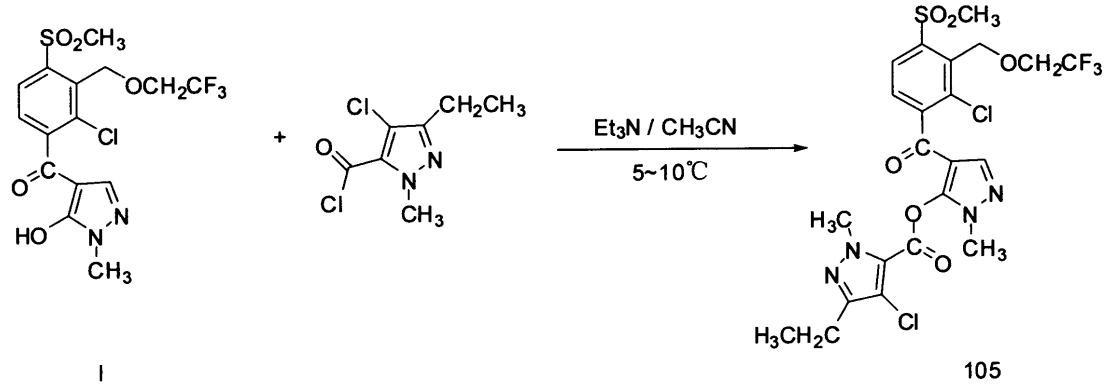
実施態様１０３～１０４では、表１のそれぞれ化合物１０３～化合物１０４の合成物を得、その合成方法は実施態様１０２と類似していたため、ここではそれらの説明を記載しない。

【０１０９】

実施態様１０５

本実施態様は、表１の化合物１０５の特定の合成を詳説するものである。化合物１０５は次の反応経路を通じて合成することができる。

【化３２】



【０１１０】

実験操作

化合物ｌを２．１ｇ（０．００５ｍｏｌ）計量し、１００ｍｌのフラスコへ添加し、続けてアセトニトリル１５ｍｌおよびトリエチルアミン１．０ｇ（０．０１０ｍｏｌ）を添加した。得られた反応液混合物を氷水浴条件下で撹拌した。１－メチル－３－エチル－４－クロロピラゾール－５－ホルミルクロリドを１．２ｇ（０．００６ｍｏｌ）計量し、アセトニトリル１０ｍｌ中に溶解させた。得られた溶液を滴下漏斗に入れ、氷水浴条件下で反応システム中に投入した。化合物ｌが完全に消費されるまで、反応をＨＰＬＣで追跡した。その後、水１００ｍｌおよび酢酸エチル１００ｍｌを添加した。得られた水層を抽出によって除去した。得られた有機層を１００ｍｌの飽和食塩水で２回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、回転式蒸発によって濃縮して淡褐色固体を得、これを９５％エタノール中で再結晶化に供して淡黄色粉末固体、即ち、化合物１０５を　１．７ｇ得た。ＨＰＬＣによって決定された含有量は９５．３％であり、収率は５４．２％であった。

【０１１１】

^{1}Ｈ　ＮＭＲデータ：表１を参照のこと。

【０１１２】

実施態様１０６～１０７では、表１のそれぞれ化合物１０６～化合物１０７の合成物を得、その合成方法は実施態様１０５と類似していたため、ここではそれらの説明を記載しない。

【０１１３】

生物活性評価：

有害な植物破壊の活性レベル基準（即ち、成長抑制率）は、以下のとおりである：

レベル１０：完全に枯死；
レベル９：成長抑制率９０％超；
レベル８：成長抑制率８０％超；
レベル７：成長抑制率７０％超；
レベル６：成長抑制率６０％超；
レベル５：成長抑制率５０％超；
レベル４：成長抑制率３０％超；
レベル３：成長抑制率２０％超；
レベル２：成長抑制率１０％超；
レベル１：成長抑制率１～１０％超；
レベル０：効果なし

上記の成長制御率は生体重制御率である。

【０１１４】

出芽後試験実験：単子葉および双子葉の雑草種子ならびに主要作物種子（即ち、小麦、

トウモロコシ、コメ、大豆、綿、油料種子、キビおよびモロコシ属）を土壌と一緒にプラスチックポットに入れた。その後、土で０．５～２ｃｍ覆い、良好な温室環境中で種子を成長させた。試験植物を播種から２～３週間後に２～３葉期で処理した。本発明の試験化合物をそれぞれアセトンで溶解させ、次に８０　ｔｗｅｅｎを添加し、一定量の水で一定の濃度まで希釈した。溶液を噴霧器で植物に噴霧した。その後、植物を温室内で３週間培養した。３週後の雑草防除効果の実験結果を表２に列挙する。

【０１１５】

【表２】

表２：出芽後段階での雑草防除効果に関する実験

化合物シリアル番号	ｇ／ｈａ	エノコログサ (Setaria viridis)	イヌビエ (Echinochloa crus-galli)	オニヒメシバ (Digitaria sanguinalis)	イヌガラシ (Rorippa indica)	アブチロン属 (Abutilon theophrasti)	センダングサ属 (Bidens pilosa)	トウモロコシ	小麦	コメ
1	60	10	10	10	10	10	8	1	1	1
2	120	6	10	2	10	8	9	0	0	1
3	120	6	10	0	0	4	6	0	0	0
4	120	5	10	1	4	6	6	0	0	0
5	120	5	10	9	10	9	8	0	0	1
6	120	6	10	2	10	7	9	0	0	1
7	120	5	10	1	4	6	6	0	0	0
8	60	7	9	7	10	10	8	1	1	1
9	120	6	9	2	10	7	9	0	0	1

10	120	7	10	2	10	7	9	0	0	1
11	120	6	10	0	0	4	6	0	0	0
12	120	1	10	0	4	6	6	0	0	0
13	60	7	10	10	10	10	8	0	1	1
14	120	1	10	0	4	6	6	0	0	0
15	120	5	10	4	10	9	8	0	0	1
16	60	8	10	10	10	10	8	0	1	1
17	120	1	10	0	4	6	6	0	0	0
18	120	5	10	4	10	9	8	0	0	1
19	60	8	10	10	10	10	8	0	0	1
20	120	5	10	1	4	6	6	0	0	0
21	120	3	10	1	4	6	6	0	0	0
22	120	3	10	1	4	6	6	0	0	0
23	120	3	10	1	4	6	6	0	0	0
24	120	2	9	1	4	6	6	0	0	0

25	30	9	10	10	5	7	7	0	0	6
26	30	10	10	10	8	7	8	1	0	5
27	30	6	9	7	5	7	7	0	0	6
28	30	5	9	7	5	7	7	0	0	6
29	15	10	8	9	4	8	5	0	0	3
30	120	10	8	4	4	6	6	0	0	0
31	30	9	10	10	5	7	7	0	0	5
32	30	10	10	10	5	7	7	1	0	5
33	30	9	9	9	5	7	7	1	0	5
34	60	8	10	10	10	10	8	0	0	1
35	30	6	10	7	5	7	7	1	0	5
36	60	7	10	10	10	10	8	0	0	1
37	60	5	9	10	10	10	8	0	0	1
38	60	10	8	8	10	10	8	0	0	1
39	60	10	10	9	10	10	8	0	0	1

40	30	9	10	10	10	7	7	0	0	5
41	30	10	10	8	10	7	7	0	0	5
42	30	9	10	7	10	7	7	0	0	5
43	30	9	10	7	10	7	7	0	0	3
44	30	9	10	10	10	7	7	0	0	3
45	30	7	9	7	10	7	7	0	0	3
46	30	10	10	10	10	7	7	1	0	3
47	30	9	10	7	10	7	7	0	0	3
48	30	9	10	7	10	7	7	0	0	3
49	30	9	10	7	10	7	7	0	0	3
50	30	9	10	8	10	6	7	0	0	3
51	30	10	10	10	10	7	7	4	0	3
52	30	6	10	7	10	7	7	1	0	3
53	30	6	10	8	10	7	7	1	0	3
54	30	10	10	7	10	7	7	1	0	3

55	30	10	10	10	10	10	7	0	2	0	3
56	30	9	10	7	10	7	7	0	0	0	3
57	30	9	10	7	10	7	7	0	0	0	3
58	30	9	10	7	10	7	7	0	0	0	3
59	30	6	8	7	10	7	7	0	0	0	3
60	30	7	10	7	7	6	4	0	0	0	5
61	30	5	10	7	10	7	7	0	0	0	3
62	30	7	10	7	10	7	7	0	0	0	3
63	30	10	10	10	10	7	7	1	0	0	6
64	30	10	10	9	10	5	5	2	0	0	3
65	30	6	10	7	10	6	7	0	0	0	3
66	30	5	10	7	10	7	7	0	0	0	3
67	30	9	10	7	10	7	7	1	0	0	3
68	30	9	10	7	10	7	7	0	0	0	3
69	30	6	10	6	10	7	7	0	0	0	3

70	30	10	10	10	10	7	7	3	0	3
71	30	5	8	7	10	6	8	0	0	3
72	30	8	10	8	10	7	7	2	0	3
73	30	9	10	9	10	7	7	0	0	3
74	30	6	10	6	10	7	5	0	0	3
75	30	7	10	9	10	5	6	0	0	3
76	30	10	10	7	10	7	7	1	0	3
77	30	10	10	7	10	7	7	1	0	3
78	30	10	10	7	10	7	7	1	0	3
79	120	3	10	1	4	6	6	0	0	0
80	30	6	10	7	10	6	7	0	0	3
81	120	3	10	1	4	6	6	0	0	0
82	120	3	10	1	4	6	6	0	0	0
83	30	8	9	8	10	6	7	0	0	3
84	120	3	10	1	4	6	6	0	0	0

85	30	8	9	8	10	6	7	0	0	3
86	30	8	8	8	10	6	7	0	0	3
87	120	3	10	1	4	6	6	0	0	0
88	30	8	7	8	10	6	7	0	0	3
89	30	8	10	7	10	7	7	1	0	1
90	30	10	10	10	10	7	7	1	0	3
91	120	3	10	1	4	6	6	0	0	0
92	30	10	10	8	10	5	7	1	0	3
93	120	3	10	1	4	6	6	0	0	0
94	60	10	8	8	10	10	8	0	0	3
95	120	3	10	1	4	6	6	0	0	0
96	60	10	10	8	10	10	8	0	0	4
97	120	3	10	1	4	6	6	0	0	0
98	30	10	10	8	10	5	7	1	0	5
99	30	8	10	7	10	7	7	1	0	1

100	30	10	10	7	10	7	7	1	0	5
101	250	7	9	6	10	7	7	1	0	8
102	30	6	10	7	10	7	7	1	0	5
103	120	3	10	2	10	7	7	1	0	0
104	60	10	10	10	10	10	8	0	0	4
105	60	10	10	9	10	10	8	0	0	4
106	60	10	10	8	10	10	8	0	0	1
107	60	10	10	8	10	10	8	0	0	7

【０１１６】

発芽前段階の雑草効果に関する実験
単子葉および双子葉の雑草ならびに主要作物（例えば、小麦、トウモロコシ、コメ、大豆、綿、油料種子、キビおよびモロコシ属）の種子を土壌が入ったプラスチックポットに入れ、土で０．５～２ｃｍ覆った。本発明の試験化合物をアセトンで溶解し、次に、ｔｗｅｅｎ　８０を添加し、一定量の水で一定の濃度まで希釈し、播種直後に噴霧した。試験結果は３週後に観察されたものである。除草剤は、特にイヌビエ（Ｅｃｈｉｎｏｃｈｌｏａ　ｃｒｕｓ－ｇａｌｌｉ）、オニヒメシバ（Ｄｉｇｉｔａｒｉａ　ｓａｎｇｕｉｎａｌｉｓ）および　アブチロン属（Ａｂｕｔｉｌｏｎ　ｔｈｅｏｐｈｒａｓｔｉ）などの雑草に対して、適用率２５０ｇ／ｈａでほとんど優れた効果を有すると観察された。多くの化合物はトウモロコシ、小麦、コメ、大豆、アブラナ等に良好な選択性を有していた。
【０１１７】
稲田での移植したコメの安全性評価および雑草防除効果評価：
稲田土を１／１，０００，０００ｈａポットに入れた。ヒエ属（ｅｃｈｉｎｏｃｈｌｏａ）、イヌホタルイ属（ｓｃｉｒｐｕｓ　ｊｕｎｃｏｉｄｅｓ）、タウコギ（ｂｉｄｅｎｓ　ｔｒｉｐａｒｔｉｔｅ）、オモダカ（ｓａｇｉｔｔａｒｉａ　ｔｒｉｆｏｌｉａ）の種子を播種し、優しく土で覆い、次に、温室内で０．５～１ｃｍの貯水状態下で放置した。オモダカ（ｓａｇｉｔｔａｒｉａ　ｔｒｉｆｏｌｉａ）の塊茎を翌日または２日後に植えた。その後、それを３～４ｃｍの貯水で維持した。ヒエ属（ｅｃｈｉｎｏｃｈｌｏａ）、イヌホタルイ属（ｓｃｉｒｐｕｓ　ｊｕｎｃｏｉｄｅｓ）およびタウコギ（ｂｉｄｅｎｓ　ｔｒｉｐａｒｔｉｔｅ）が０．５葉期に達し、かつオモダカ（ｓａｇｉｔｔａｒｉａ　ｔｒｉｆｏｌｉａ）が初生葉期の時点に達した際に、本発明の化合物の共通の調製方法によって調製したＷＰまたはＳＣ水希釈剤を、特定の有効量を達成するためにピペットで均一に滴下することによって雑草を処理した。
【０１１８】
さらに、１／１，０００，０００ｈａポットに入れた稲田土は貯水を深さ３～４ｃｍに維持するために水平にした。翌日、３葉期コメ（ジャポニカ米）を移植深さ３ｃｍで移植した。本発明の化合物を移植から５日間後に同一の方法で処理した。
【０１１９】
本発明の化合物の処理から１４日後の、ヒエ属（ｅｃｈｉｎｏｃｈｌｏａ）、イヌホタルイ属（ｓｃｉｒｐｕｓ　ｊｕｎｃｏｉｄｅｓ）、タウコギ（ｂｉｄｅｎｓ　ｔｒｉｐａｒｔｉｔｅ）およびオモダカ（ｓａｇｉｔｔａｒｉａ　ｔｒｉｆｏｌｉａ）の産出条件および　本発明の化合物の処理から２１日後のコメの産出条件をそれぞれ肉眼で評価した。雑草防除効果を１～１０の活性標準レベルで評価し、表３に示す。
【０１２０】

【表３】

表３：移植した稲田（５００ｇａ．ｉ．／ｈａ）での雑草防除効果の実験結果

化合物シリアル番号	イヌビエ	イヌホタルイ属	ミズアオイ属	コメ	適用率（ｇ／ｈａ）
2	10	10	9	0	500
6	10	10	10	1	500
10	10	10	10	1	500
24	10	10	9	1	60
36	9	10	10	0	60
40	10	9	9	0	60
46	8	9	9	0	60
51	10	9	10	0	60
60	10	10	10	2	60
68	7	10	10	1	60
76	10	10	10	0	60
90	10	10	10	0	60
100	10	10	8	0	60
107	9	10	10	10	60

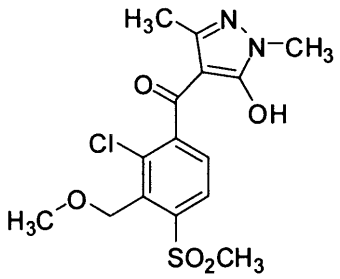
【０１２１】

中国、黒竜江省および江蘇省から、ヒエ属（ｅｃｈｉｎｏｃｈｌｏａ）、イヌホタルイ属（ｓｃｉｒｐｕｓ　ｊｕｎｃｏｉｄｅｓ）およびミズアオイ属（ｍｏｎｏｃｈｏｒｉａ　ｖａｇｉｎａｌｉｓ）の種子を回収した。試験から、雑草が共通量のピラゾスルフロン－エチルに耐性であることが示された。

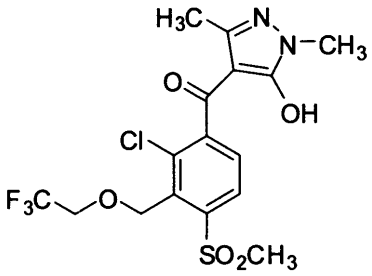
【０１２２】

対照実験：

対照としての化合物Ａ：
【化３３】



対照としての化合物Ｂ：
【化３４】



対照化合物は特許ＣＮ８８１０１４５５Ａで示されたものから選択した。
【０１２３】
出芽後段階試験：単子葉の雑草およびトウモロコシの種子を土が入ったプラスチックポットに入れ、土で０．５～２ｃｍ覆い、良好な温室環境内で成長させた。４週間後、試験植物を５～６葉期で処理した。本発明の試験化合物をアセトンでそれぞれ溶解させ、次に、ｔｗｅｅｎ　８０を添加し、一定量の水で一定の濃度まで希釈した。溶液を噴霧塔によって植物に噴霧した。試験適用率は１５ｇ／ｈａであり、観察期間は２５日であった。
【０１２４】

【表４】

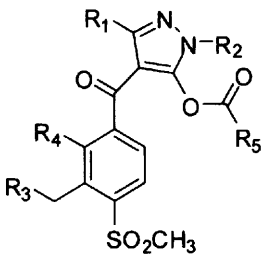
表４：対照実験の結果

化合物	オニヒメシバ	イヌビエ	エノコログサ	トウモロコシ
化合物２６	10	10	10	0
対照としての化合物Ａ	6	7	7	1
化合物２９	10	8	9	0
対照としての化合物Ｂ	5	6	7	0

【０１２５】
表４は、本発明の化合物が対照の化合物より良好な除草活性および安全性を有することを示している。
【０１２６】
同時に、幾つかの試験度に、本発明の化合物が、シバ属（ｚｏｙｓｉａ　ｊａｐｏｎｉｃａ）、ギョウギシバ（ｂｅｒｍｕｄａ　ｇｒａｓｓ）、ヒロハノウシノケグサ（ｔａｌｌ　ｆｅｓｃｕｅ）、チゴツナギ（ｂｌｕｅｇｒａｓｓ）、ライグラス（ｒｙｅｇｒａｓｓ）およびシーショアスズメノヒエ属（　ｓｅａｓｈｏｒｅ　ｐａｓｐａｌｕｍ　）等の

多数のイネ科草（ｇｒａｍｉｎｅａｅ　ｇｒａｓｓ）に良好な選択性を有し、多数の重要なイネ科雑草および広葉雑草を防除することができることが見出された。また化合物も、異なる除草剤適用方法での、大豆、綿、油ヒマワリ、ジャガイモ、果樹類および野菜類の試験で優れた選択性および商品価値を示す。

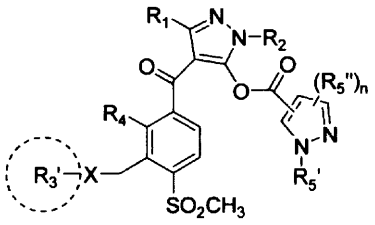
【手続補正書】
【提出日】平成30年7月18日(2018.7.18)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
下記式（Ｉ）のピラゾール化合物またはその塩：
【化１】



(I)

［式中、
Ｒ$_1$は、水素またはＣ１～Ｃ４アルキルを表し；
Ｒ$_2$は、Ｃ１～Ｃ３アルキルを表し；
Ｒ$_3$は、Ｏ、ＳおよびＮから選択された１つ以上のヘテロ原子を含有するＣ１～Ｃ６の直鎖または環式基を表し；
Ｒ$_4$は、Ｃ１～Ｃ３アルキルまたはハロゲンを表し；
Ｒ$_5$は、ピラゾール環、またはアルキル、アルコキシル、ハロゲン、ハロゲン化アルキル、アミノおよびニトロから選択された１つ以上の基で置換されたピラゾール環を表す］。
【請求項２】
前記化合物が、下記式（Ｉ’）の構造を有する、請求項１に記載のピラゾール化合物またはその塩：

【化２】

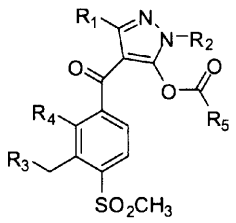


(I')

［式中、
R_1は、水素またはC_1～C_4アルキルを表し；
R_2は、C_1～C_3アルキルを表し；
Xは、O、NまたはSを表し、かつXおよびR_3'は、環または直鎖を形成していてもよく、ここで、XがOまたはSである場合、R_3'は、C_1～C_6アルキル、C_3～C_6アルコキシルアルキル、C_2～C_6ハロゲン化アルキル、C_3～C_6アルケニルまたはC_3～C_6アルキニルを表し；XがNである場合、XおよびR_3'は、ピラゾール環または置換されたピラゾール環、C_3～C_5ラクタム環または置換されたラクタム環を形成し、
R_4は、C_1～C_3アルキルまたはハロゲンを表し；
R_5'は、C_1～C_3アルキルを表し；
R_5''は、水素、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシル、C_1～C_3ハロゲン化アルキル、ハロゲン、アミノまたはニトロを表し；ｎは、０、１または２であり、ここで、ｎが２である場合、二つのR_5''は、同一であっても異なっていてもよい］。
【請求項３】
R_1が、水素、メチル、エチルまたはシクロプロピルを表し；
R_2が、メチル、エチルまたはイソプロピルを表し；
Xが、O、NまたはSを表し、XおよびR_3'が、環または直鎖を形成していてもよく、ここで、XがOまたはSである場合、R_3'が、C_1～C_6アルキル、C_3～C_6アルコキシルアルキル、C_2～C_4ハロゲン化アルキル、C_3～C_5アルケニルまたはC_3～C_5アルキニルを表し；XがNである場合、XおよびR_3'が、ピラゾール環または置換されたピラゾール環、C_3～C_5ラクタム環または置換されたラクタム環を形成し、
R_4が、メチルまたは塩素を表し；
R_5'が、メチル、エチルまたはイソプロピルを表し；
R_5''が、水素、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシル、エトキシル、ジフルオロメチル、クロロまたはブロモを表し；ｎが０、１または２であり、ここで、ｎが２である場合、二つのR_5''は、同一であっても異なっていてもよい、請求項２に記載のピラゾール化合物またはその塩。
【請求項４】
Xが、OまたはNを表し、XおよびR_3'が、環または直鎖を形成していてもよく、ここで、XがOである場合、R_3'が、メチル、エチル、ｎ－ブチル、メトキシルエチル、エトキシルエチル、メトキシルイソプロピル、メトキシルｎ－プロピル、２，２－ジフルオロエチル、２，２，２－トリフルオロエチル、１，１，２，２－テトラフルオロプロピル、プロパルギル、２－ブテニルまたはテトラヒドロフルフリルを表し；XがNである場合、XおよびR_3'が、ピラゾール環、３－メチルピラゾール環、４－メチルピラゾール環、３，５－ジメチルピラゾール環、４－クロロピラゾール環またはピロリドン環を形成する、請求項３に記載のピラゾール化合物またはその塩。
【請求項５】

前記化合物が、以下から選択されるものである、請求項１に記載のピラゾール化合物またはその塩：

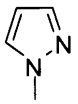
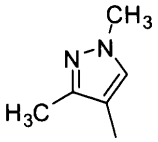
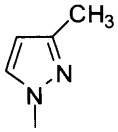
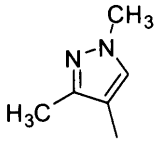
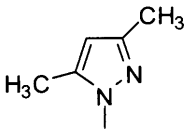
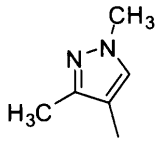
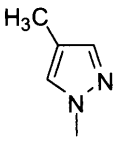
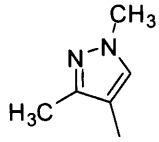
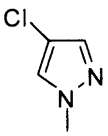
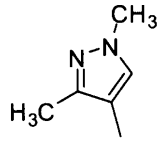
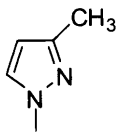
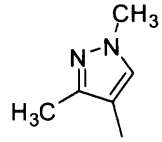
【化３】

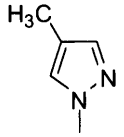
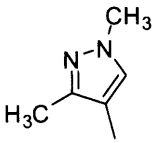
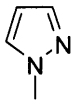
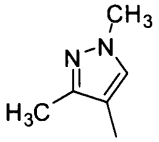
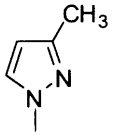
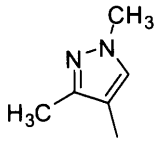
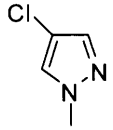
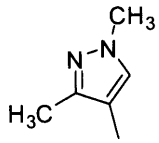
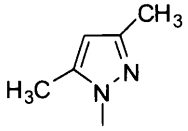
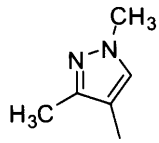
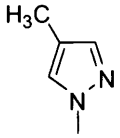
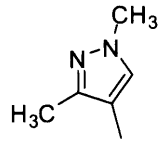
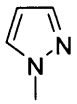
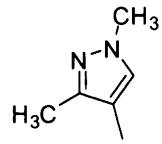


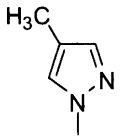
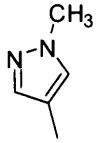
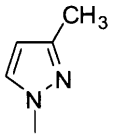
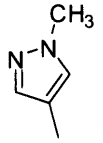
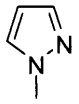
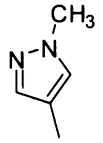
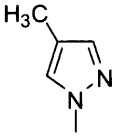
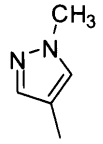
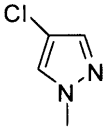
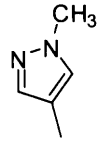
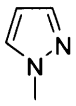
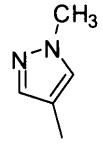
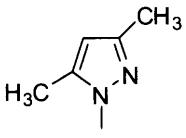
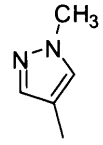
(I)

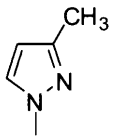
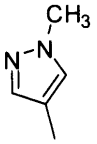
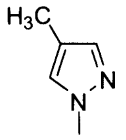
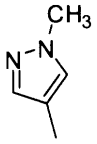
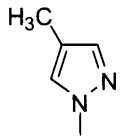
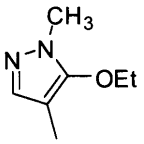
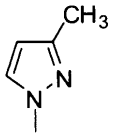
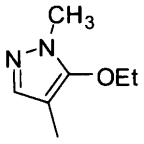
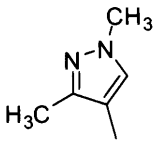
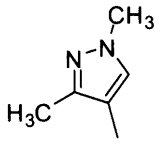
【表１】

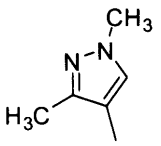
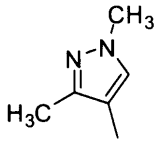
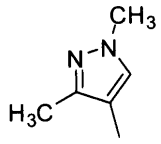
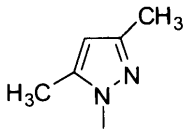
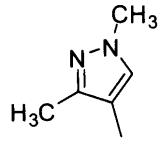
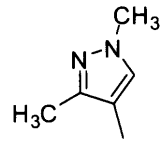
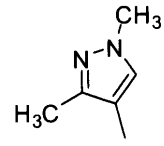
【表１】

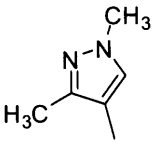
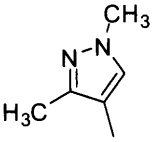
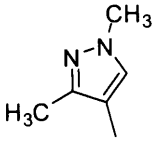
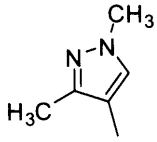
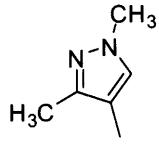
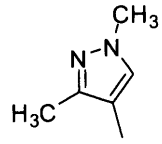
番号	R_1	R_2	R_3	R_4	R_5
01	—CH_3	—CH_3		—Cl	
02	—CH_3	—CH_3		—Cl	
03	—CH_3	—CH_3		—Cl	
04	—CH_3	—CH_3		—Cl	
05	—CH_3	—CH_3		—Cl	
06	—H	—CH_3		—Cl	

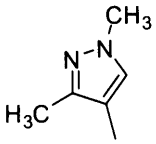
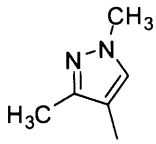
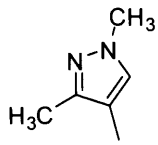
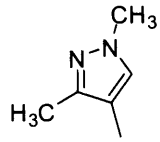
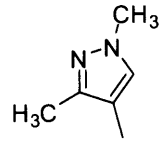
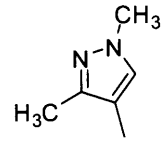
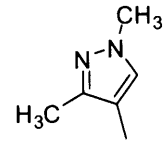
07	—H	—CH_3		—Cl	
08	—H	—CH_3		—Cl	
09		—CH_3		—Cl	
10		—CH_3		—Cl	
11		—CH_3		—Cl	
12		—CH_3		—Cl	
13		—CH_3		—Cl	

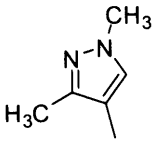
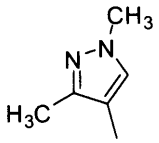
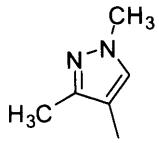
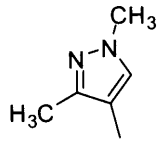
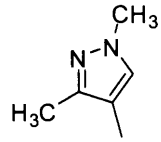
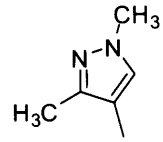
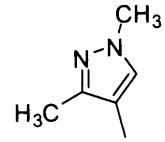
14	—CH_3	—CH_3		—Cl	
15	—CH_3	—CH_3		—Cl	
16	—CH_3	—CH_3		—Cl	
17	—H	—CH_3		—Cl	
18		—CH_3		—Cl	
19		—CH_3		—Cl	
20		—CH_3		—Cl	

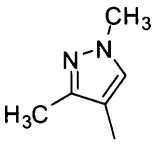
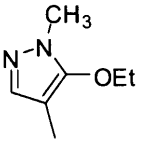
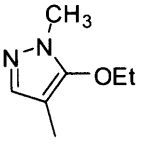
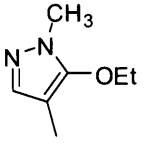
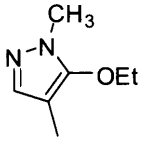
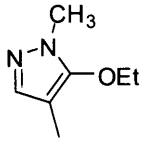
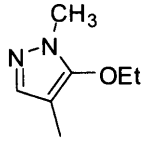
21		—CH_3		—Cl	
22		—CH_3		—Cl	
23	—H	—CH_3		—Cl	
24	—H	—CH_3		—Cl	
25	—CH_3	—CH_3	—OCH_2CHF_2	—Cl	
26	—CH_3	—CH_3	—OCH_3	—Cl	

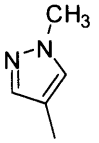
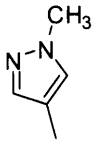
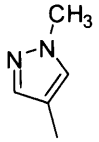
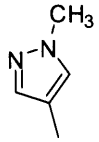
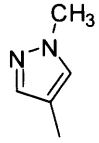
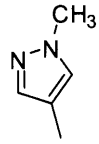
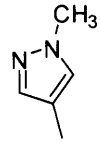
27	$-CH_3$	$-CH_3$	$-OCH_2CH_3$	$-Cl$	
28	$-CH_3$	$-CH_3$	$-OCH_2CH_2OCH_3$	$-Cl$	
29	$-CH_3$	$-CH_3$	$-OCH_2CF_3$	$-Cl$	
30	$-CH_2CH_3$	$-CH_3$		$-Cl$	
31	$-CH_2CH_3$	$-CH_3$	$-OCH_2CH_3$	$-Cl$	
32	$-CH_2CH_3$	$-CH_3$	$-OCH_2CF_3$	$-Cl$	

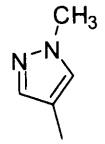
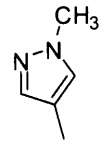
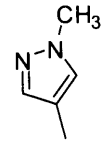
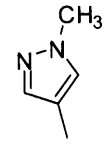
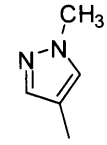
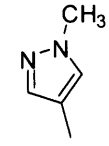
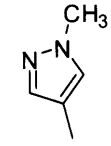
33	$-CH_3$	$-CH_3$	$HC\equiv C-CH_2O-$	$-Cl$	
34	$-CH_3$	$-CH_3$	$-OCH_2CH_2CH_2CH_3$	$-Cl$	
35	$-CH_3$	$-CH_3$	$-OCH_2CF_2CHF_2$	$-Cl$	
36	$-CH_3$	$-CH_3$	$CH_3OCH_2\underset{O}{\overset{/}{C}}HCH_3$	$-Cl$	
37	$-CH_3$	$-CH_3$	$-OCH_2CH_2CH_2OCH_3$	$-Cl$	
38	$-CH_3$	$-CH_3$	$H_3C-\underset{H}{C}=\underset{H}{C}-CH_2O-$	$-Cl$	

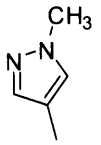
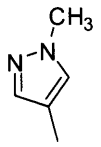
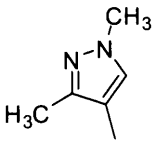
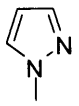
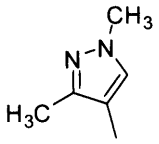
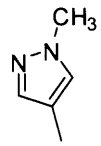
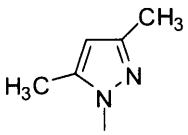
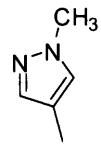
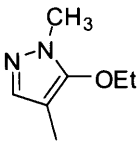
39	—CH_3	—CH_3	—$OCH_2CH_2OCH_2CH_3$	—Cl	
40	—H	—CH_3	—OCH_2CHF_2	—Cl	
41	—H	—CH_3	$HC\equiv C-CH_2O$—	—Cl	
42	—H	—CH_3	—OCH_2CH_3	—Cl	
43	—H	—CH_3	$H_3C-C(H)=C(H)-CH_2O$—	—Cl	
44	—H	—CH_3	—OCH_2CF_3	—Cl	
45	—H	—CH_3	—$OCH_2CH_2OCH_2CH_3$	—Cl	

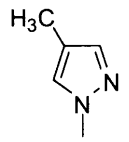
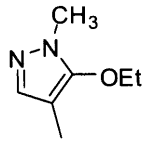
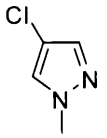
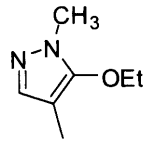
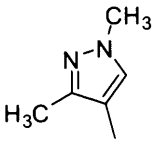
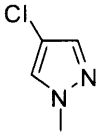
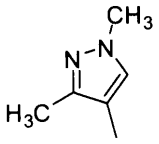
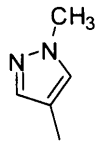
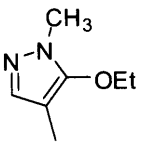
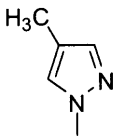
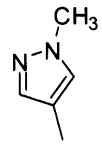
46		$-CH_3$	$-OCH_2CH_3$	$-Cl$	
47		$-CH_3$	$HC\equiv C-CH_2O-$	$-Cl$	
48		$-CH_3$	$-OCH_2CF_2CHF_2$	$-Cl$	
49		$-CH_3$	$-OCH_2CF_3$	$-Cl$	
50		$-CH_3$	$-OCH_2CHF_2$	$-Cl$	
51		$-CH_3$	$-OCH_3$	$-Cl$	
52		$-CH_3$	$-OCH_2CH_2CH_2OCH_3$	$-Cl$	

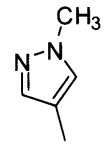
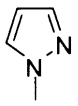
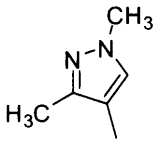
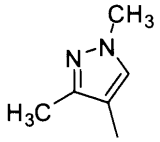
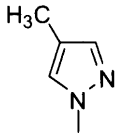
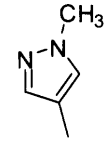
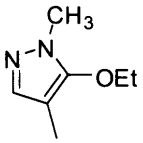
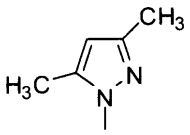
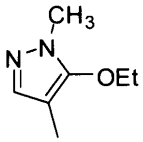
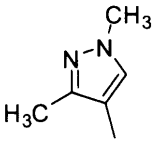
53	—H	—CH_3	—$OCH_2CH_2CH_2OCH_3$	—Cl	
54	—H	—CH_3	—OCH_2CF_3	—Cl	
55	—CH_3	—CH_3	—OCH_2CF_3	—Cl	
56	—CH_3	—CH_3	$HC\equiv C-CH_2O$—	—Cl	
57	—H	—CH_3	—OCH_2CHF_2	—Cl	
58	—H	—CH_3	$HC\equiv C-CH_2O$—	—Cl	
59	—H	—CH_3	—$OCH_2CH_2OCH_2CH_3$	—Cl	

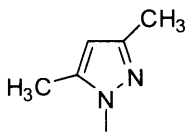
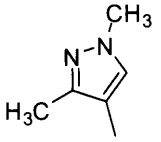
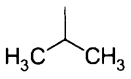
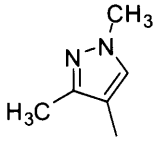
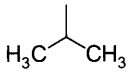
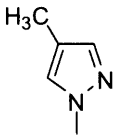
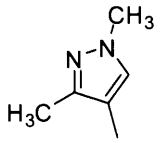
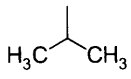
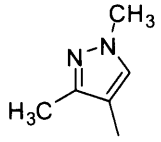
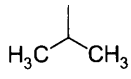
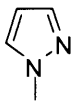
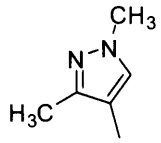
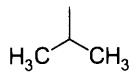
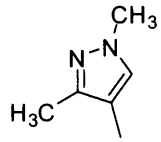
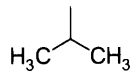
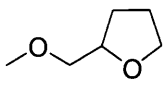
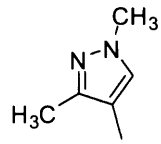
60		—CH_3	$HC{\equiv}C-CH_2O-$	—Cl	
61	—H	—CH_3	$HC{\equiv}C-CH_2O-$	—Cl	
62	—H	—CH_3	—$OCH_2CH_2CH_2OCH_3$	—Cl	
63	—CH_3	—CH_3	—OCH_2CF_3	—Cl	
64	—CH_3	—CH_3	—OCH_2CHF_2	—Cl	
65	—CH_3	—CH_3	—$OCH_2CF_2CHF_2$	—Cl	
66	—CH_3	—CH_3	—$OCH_2CH_2CH_2OCH_3$	—Cl	

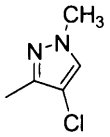
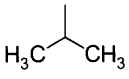
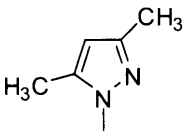
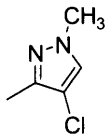
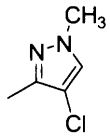
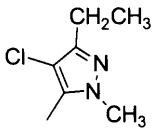
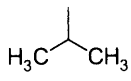
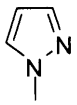
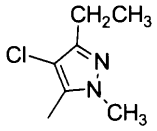
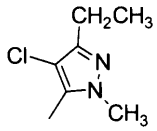
67	—H	—CH_3	—OCH_2CF_3	—Cl	
68	—H	—CH_3	—$OCH_2CH_2OCH_2CH_3$	—Cl	
69	—CH_3	—CH_3	$HC\equiv C-CH_2O$—	—Cl	
70		—CH_3	—OCH_2CH_3	—Cl	
71		—CH_3	—$OCH_2CF_2CHF_2$	—Cl	
72		—CH_3	—OCH_3	—Cl	
73	—CH_3	—CH_3	—OCH_2CH_3	—Cl	

74		—CH_3	—$OCH_2CH_2OCH_2CH_3$	—Cl	
75		—CH_3	—$OCH_2CH_2CH_2CH_3$	—Cl	
76	—CH_3	—CH_3	$HC\equiv C-CH_2O$—	—CH_3	
77	—H	—CH_3		—CH_3	
78		—CH_3	—OCH_2CF_3	—CH_3	
79	—CH_3	—CH_3		—CH_3	
80	—H	—CH_3	—OCH_2CH_3	—CH_3	

81		—CH_3		—CH_3	
82	—CH_3	—CH_2CH_3		—CH_3	
83	—H	—CH_2CH_3	—$OCH_2CH_2CH_2OCH_3$	—CH_3	
84		—CH_2CH_3		—CH_3	
85	—CH_3	—CH_2CH_3	—$OCH_2CF_2CHF_2$	—CH_3	
86		—CH_2CH_3	—$OCH_2CH_2OCH_2CH_3$	—CH_3	
87	—H	—CH_2CH_3		—CH_3	

88	—H	—CH_2CH_3	$H_3C-C(H)=C(H)-CH_2O-$	—Cl	
89	—CH_3	—CH_2CH_3		—Cl	
90		—CH_2CH_3	—OCH_2CHF_2	—Cl	
91		—CH_2CH_3		—Cl	
92	—CH_3	—CH_2CH_3	—OCH_3	—Cl	
93	—H	—CH_2CH_3		—Cl	
94	—CH_2CH_3	—CH_2CH_3	—OCH_2CHF_2	—Cl	

95	$-CH_2CH_3$	$-CH_2CH_3$		—Cl	
96			$-OCH_2CH_3$	—Cl	
97	—H			—Cl	
98	$-CH_3$		$-OCH_2CF_3$	—Cl	
99	$-CH_2CH_3$			—Cl	
100	—H		$HC\equiv C-CH_2O-$	—Cl	
101	$-CH_3$			—Cl	

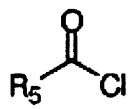
102	—H	—CH_3	—OCH_2CHF_2	—Cl	
103	—CH_3			—Cl	
104	—CH_2CH_3	—CH_2CH_3	—OCH_2CH_3	—Cl	
105	—H	—CH_3	—OCH_2CF_3	—Cl	
106	—CH_3			—Cl	
107	—CH_2CH_3	—CH_2CH_3	HC≡C—CH_2O—	—Cl	

【請求項６】

式（ＩＩ）の化合物および式（ＩＩＩ）の化合物をエステル化反応に供してピラゾール化合物またはその塩を得る、請求項１に記載のピラゾール化合物またはその塩を製造する方法であって、

該式（ＩＩ）の化合物が以下の通りに示され：

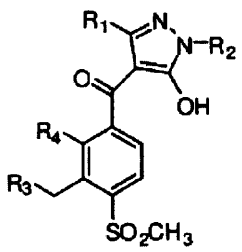
【化４】



II

該式（ＩＩＩ）の化合物が以下の通りに示される、方法：

【化５】



(III)

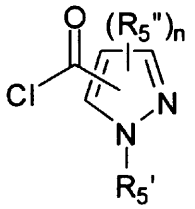
。

【請求項７】

式（ＩＩ’）の化合物および式（ＩＩＩ’）の化合物をエステル化反応に供してピラゾール化合物またはその塩を得る、請求項２～４のいずれか一項に記載のピラゾール化合物またはその塩の製造方法であって、

該式（ＩＩ’）の化合物が以下の通りに示され：

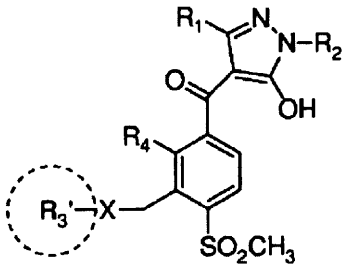
【化６】



(II')

該式（ＩＩＩ’）の化合物が以下の通りに示される、方法：

【化７】



(III')

。

【請求項８】

前記反応が、０．１～１２時間、好ましくは０．５～３時間、温度－１０～５０℃、好ましくは０～２０℃で溶媒およびアルカリの存在下で行われ、該溶媒が、アセトニトリル

またはジクロロメタンであって、該アルカリがトリエチルアミンまたは炭酸カリウムである、請求項６または７に記載の方法。
【請求項９】
除草上有効量の、請求項１～５のいずれか一項に記載の少なくとも１つのピラゾール化合物またはその塩を含んでなる、除草組成物。
【請求項１０】
さらに調製補助剤を含んでなる、請求項９に記載の除草組成物。
【請求項１１】
除草上有効量の、請求項１～５のいずれか一項に記載の少なくとも１つのピラゾール化合物もしくはその塩または請求項９もしくは１０に記載の除草組成物を、植物または植物が存在する領域に適用する工程を含んでなる、有害植物を防除する方法。
【請求項１２】
有害植物の防除における、請求項１～５のいずれか一項に記載の少なくとも１つのピラゾール化合物もしくはその塩または請求項９もしくは１０に記載の除草組成物の使用。
【請求項１３】
前記ピラゾール化合物またはその塩が、所望の作物中の有害植物の防除に使用される、請求項１２に記載の使用。
【請求項１４】
前記所望の作物が、遺伝子組換え作物またはゲノム編集技術により処理された作物である、請求項１３に記載の使用。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/CN2016/075578

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D 231/20 (2006.01) i; C07D 405/14 (2006.01) i; A01N 43/56 (2006.01) i; A01P 13/00 (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)

C07D 231/-; C07D 405/-; A01N 43/-; A01P 13/00

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)

CNKI, CNABS, VEN, REGISTRY, CAPLUS: QINGDAO QINGYUAN; sulfonyl, weeding, pyrazolone, herbicide

CAS RN: 1911615-02-5, 1889333-20-3, structure retrieval for general formula compound of claim 1

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 2106697 A1 (ISHIHARA SANGYO KAISHA LTD.), 07 October 2009 (07.10.2009), claims 1, 9-10, and description, page 41, compound 25	1-13
Y	CN 103980202 A (QINGDAO QINGYUAN CHEMICAL COMPOUND CO., LTD.), 13 August 2014 (13.08.2014), claim 8, and description, page 4, paragraph [0044], page 5, paragraphs [0050]-[0051] and page 11, compounds 20, 21 and 42	1-13
Y	US 6156702 A (BASF AG), 05 December 2000 (05.12.2000), description, table A, compounds 76-80 and column 32, table 25	1-13
A	WO 0003993 A1 (ISHIHARA SANGYO KAISHA LTD.), 27 January 2000 (27.01.2000), the whole document	1-13
A	WO 9842648 A1 (DOW AGROSCIENCES LLC), 01 October 1998 (01.10.1998), the whole document	1-13
A	CN 88101455 A (NISSAN CHEMICAL IND LTD.), 28 September 1988 (28.09.1988), the whole document	1-13

☐ 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
27 September 2016 (27.09.2016)	**10 October 2016 (10.10.2016)**
Name and mailing address of the ISA/CN: State Intellectual Property Office of the P. R. China No. 6, Xitucheng Road, Jimenqiao Haidian District, Beijing 100088, China Facsimile No.: (86-10) 62019451	Authorized officer **ZHOU, Yu** Telephone No.: (86-10) **62086359**

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 2009)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.
PCT/CN2016/075578

Patent Documents referred in the Report	Publication Date	Patent Family	Publication Date
EP 2106697 A1	07 October 2009	WO 2008093840 A1	07 August 2008
		JP 2009013161 A	22 January 2009
		US 2010099563 A1	22 April 2010
		JP 5416354 B2	12 February 2014
		BR PI0808633 A2	05 August 2014
		EP 2106697 A4	04 December 2013
		US 8466088 B2	18 June 2013
CN 103980202 A	13 August 2014	None	
US 6156702 A	05 December 2000	EP 1003736 B1	12 April 2006
		AR 016811 A1	01 August 2001
		WO 9907697 A1	18 February 1999
		DE 59813487 D1	24 May 2006
		CA 2298589 A1	18 February 1999
		EP 1003736 A1	31 May 2000
		JP 2001512726 A	28 August 2001
		AU 9066598 A	01 March 1999
		ZA 9807055 B	07 February 2000
		ZA 9807055 A	07 February 2000
WO 0003993 A1	27 January 2000	AU 4652499 A	07 February 2000
WO 9842648 A1	01 October 1998	None	
CN 88101455 A	28 September 1988	RU 2055836 C1	10 March 1996
		JP H02173 A	05 January 1990
		DE 3855518 T2	20 February 1997
		EP 0282944 A3	09 October 1991
		DK 146488 D0	17 March 1988
		JP 2725274 B2	11 March 1998
		RU 1836018 C	23 August 1993
		JP 3008398 B2	14 February 2000
		GR 3021596 T3	28 February 1997
		YU 46637 B	20 January 1994
		YU 199189 A	30 June 1990
		EP 0282944 B1	11 September 1996
		YU 53688 A	30 April 1990
		KR 960004862 B1	16 April 1996
		DE 3855518 D1	17 October 1996
		HU T45847 A	28 September 1988
		YU 46497 B	20 October 1993
		IL 85659 D0	31 August 1988
		AU 599468 B2	19 July 1990
		JP H11171828 A	29 June 1999
		AT 142624 T	15 September 1996
		HU 204513 B	28 January 1992
		DK 170668 B1	27 November 1995
		ES 2094719 T3	01 February 1997
		CA 1328260 C	05 April 1994
		DK 146488 A	18 September 1988
		US 4948887 A	14 August 1990
		BR 8801218 A	25 October 1988
		IL 85659 A	29 March 1992

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (July 2009)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.
PCT/CN2016/075578

Patent Documents referred in the Report	Publication Date	Patent Family	Publication Date
		CN 1023011 C	08 December 1993
		EP 0282944 A2	21 September 1988
		AU 1309988 A	15 September 1988

国际检索报告

国际申请号
PCT/CN2016/075578

A. 主题的分类

C07D 231/20(2006.01)i; C07D 405/14(2006.01)i; A01N 43/56(2006.01)i; A01P 13/00(2006.01)i

按照国际专利分类(IPC)或者同时按照国家分类和IPC两种分类

B. 检索领域

检索的最低限度文献(标明分类系统和分类号)

C07D231/-; C07D405/-; A01N43/-; A01P13/00

包含在检索领域中的除最低限度文献以外的检索文献

在国际检索时查阅的电子数据库(数据库的名称，和使用的检索词（如使用）)

CNKI, CNABS, VEN, REGISTRY, CAPLUS: 青岛清原，吡唑酮，磺酰基，除草， pyrazolone, herbicide,CAS RN: 1911615-02-6，1889333-20-3，对权利要求1的通式化合物进行结构检索

C. 相关文件

类 型*	引用文件，必要时，指明相关段落	相关的权利要求
Y	EP 2106697 A1 (ISHIHARA SANGYO KAISHA LTD.) 2009年 10月 7日 (2009-10-07) 权利要求1、9-10，说明书第41页化合物25	1-13
Y	CN 103980202 A (青岛清原化合物有限公司) 2014年 8月 13日 (2014-08-13) 权利要求8，说明书第4页第[0044]段，第5页第[0050]-[0051]段，第11页化合物20、21、42	1-13
Y	US 6156702 A (BASF AG) 2000年 12月 5日 (2000-12-05) 说明书表A化合物76-80，第32栏表25	1-13
A	WO 0003993 A1 (ISHIHARA SANGYO KAISHA LTD.) 2000年 1月 27日 (2000-01-27) 全文	1-13
A	WO 9842648 A1 (DOW AGROSCIENCES LLC) 1998年 10月 1日 (1998-10-01) 全文	1-13
A	CN 88101466 A (日产化学工业株式会社) 1988年 9月 28日 (1988-09-28) 全文	1-13

☐ 其余文件在C栏的续页中列出。

☑ 见同族专利附件。

* 引用文件的具体类型：

"A" 认为不特别相关的表示了现有技术一般状态的文件

"E" 在国际申请日的当天或之后公布的在先申请或专利

"L" 可能对优先权要求构成怀疑的文件，或为确定另一篇引用文件的公布日而引用的或者因其他特殊理由而引用的文件（如具体说明的）

"O" 涉及口头公开、使用、展览或其他方式公开的文件

"P" 公布日先于国际申请日但迟于所要求的优先权日的文件

"T" 在申请日或优先权日之后公布，与申请不相抵触，但为了理解发明之理论或原理的在后文件

"X" 特别相关的文件，单独考虑该文件，认定要求保护的发明不是新颖的或不具有创造性

"Y" 特别相关的文件，当该文件与另一篇或者多篇该类文件结合并且这种结合对于本领域技术人员为显而易见时，要求保护的发明不具有创造性

"&" 同族专利的文件

国际检索实际完成的日期	国际检索报告邮寄日期
2016年 9月 27日	2016年 10月 10日
ISA/CN的名称和邮寄地址 中华人民共和国国家知识产权局(ISA/CN) 中国北京市海淀区蓟门桥西土城路6号 100088 传真号 (86-10)62019451	受权官员 周宇 电话号码 (86-10)62086359

表 PCT/ISA/210（第2页）(2009年7月)

国际检索报告
关于同族专利的信息

国际申请号
PCT/CN2016/075578

检索报告引用的专利文件			公布日（年/月/日）	同族专利			公布日（年/月/日）
EP	2106697	A1	2009年 10月 7日	WO	2008093840	A1	2008年 8月 7日
				JP	2009013161	A	2009年 1月 22日
				US	2010099563	A1	2010年 4月 22日
				JP	5416354	B2	2014年 2月 12日
				BR	PI0808633	A2	2014年 8月 5日
				EP	2106697	A4	2013年 12月 4日
				US	8466088	B2	2013年 6月 18日
CN	103980202	A	2014年 8月 13日		无		
US	6156702	A	2000年 12月 5日	EP	1003736	B1	2006年 4月 12日
				AR	016811	A1	2001年 8月 1日
				WO	9907697	A1	1999年 2月 18日
				DE	59813487	D1	2006年 5月 24日
				CA	2298589	A1	1999年 2月 18日
				EP	1003736	A1	2000年 5月 31日
				JP	2001512726	A	2001年 8月 28日
				AU	9066598	A	1999年 3月 1日
				ZA	9807055	B	2000年 2月 7日
				ZA	9807055	A	2000年 2月 7日
WO	0003993	A1	2000年 1月 27日	AU	4652499	A	2000年 2月 7日
WO	9842648	A1	1998年 10月 1日		无		
CN	88101455	A	1988年 9月 28日	RU	2055836	C1	1996年 3月 10日
				JP	H02173	A	1990年 1月 5日
				DE	3855518	T2	1997年 2月 20日
				EP	0282944	A3	1991年 10月 9日
				DK	146488	D0	1988年 3月 17日
				JP	2725274	B2	1998年 3月 11日
				RU	1836018	C	1993年 8月 23日
				JP	3008398	B2	2000年 2月 14日
				GR	3021596	T3	1997年 2月 28日
				YU	46637	B	1994年 1月 20日
				YU	199189	A	1990年 6月 30日
				EP	0282944	B1	1996年 9月 11日
				YU	53688	A	1990年 4月 30日
				KR	960004862	B1	1996年 4月 16日
				DE	3855518	D1	1996年 10月 17日
				HU	T45847	A	1988年 9月 28日
				YU	46497	B	1993年 10月 20日
				IL	85659	D0	1988年 8月 31日
				AU	599468	B2	1990年 7月 19日
				JP	H11171828	A	1999年 6月 29日
				AT	142624	T	1996年 9月 15日
				HU	204513	B	1992年 1月 28日
				DK	170668	B1	1995年 11月 27日
				ES	2094719	T3	1997年 2月 1日
				CA	1328260	C	1994年 4月 5日
				DK	146488	A	1988年 9月 18日
				US	4948887	A	1990年 8月 14日
				BR	8801218	A	1988年 10月 25日
				IL	85659	A	1992年 3月 29日

表 PCT/ISA/210（同族专利附件）（2009年7月）

国际检索报告
关于同族专利的信息

国际申请号
PCT/CN2016/075578

检索报告引用的专利文件	公布日 (年/月/日)	同族专利			公布日 (年/月/日)
		CN	1023011	C	1993年 12月 8日
		EP	0282944	A2	1988年 9月 21日
		AU	1309988	A	1988年 9月 15日

表 PCT/ISA/210（同族专利附件）（2009年7月）

フロントページの続き

(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

（特許庁注：以下のものは登録商標）
１．ＴＷＥＥＮ

(74)代理人 100082991
弁理士 佐藤 泰和
(74)代理人 100105153
弁理士 朝倉 悟
(74)代理人 100120617
弁理士 浅野 真理
(74)代理人 100126099
弁理士 反町 洋
(74)代理人 100143971
弁理士 藤井 宏行
(72)発明者 リャン、レイ
中華人民共和国シャントン、チンタオ、シナン、ディストリクト、ナンジン、ロード、ナンバー１００、ビルディング１、ルーム１４０３
(72)発明者 ツェン、ユロン
中華人民共和国シャントン、チンタオ、シナン、ディストリクト、ナンジン、ロード、ナンバー１００、ビルディング１、ルーム１４０３
(72)発明者 リ、ソン
中華人民共和国シャントン、チンタオ、シナン、ディストリクト、ナンジン、ロード、ナンバー１００、ビルディング１、ルーム１４０３
(72)発明者 ペン、シュガン
中華人民共和国シャントン、チンタオ、シナン、ディストリクト、ナンジン、ロード、ナンバー１００、ビルディング１、ルーム１４０３
(72)発明者 ジン、タオ
中華人民共和国シャントン、チンタオ、シナン、ディストリクト、ナンジン、ロード、ナンバー１００、ビルディング１、ルーム１４０３
(72)発明者 ツゥイ、キ
中華人民共和国シャントン、チンタオ、シナン、ディストリクト、ナンジン、ロード、ナンバー１００、ビルディング１、ルーム１４０３

Ｆターム(参考) 4C063 AA03 BB08 CC75 DD22 EE03
4H011 AB01 BB09 DD01 DD03 DD04

【要約の続き】
ル化合物は、作物への広範囲の生物活性および顕著な安全性を有する優れた除草剤である。