

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2010 年 8 月 12 日(12.08.2010)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2010/089993 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 215/22 (2006.01) A01P 13/00 (2006.01)
A01N 43/42 (2006.01) C07D 471/04 (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2010/000607
- (22) 国際出願日: 2010 年 2 月 2 日(02.02.2010)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願 2009-023115 2009 年 2 月 3 日(03.02.2009) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): クミアイ化学工業株式会社(KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1108782 東京都台東区池之端 1 丁目 4 番 2 6 号 Tokyo (JP). イハラケミカル工業株式会社(IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1100008 東京都台東区池之端 1 丁目 4 番 2 6 号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 高部文明 (TAKABE, Fumiaki) [JP/JP]; 〒4371213 静岡県磐田市塩新田 4 0 8 番地の 1 株式会社ケイ・アイ研究所内 Shizuoka (JP). 平野裕貴 (HIRANO, Yuuki) [JP/JP]; 〒4371213 静岡県磐田市塩新田 4 0 8

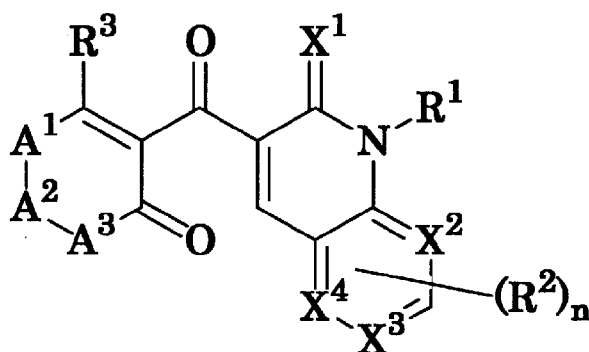
番地の 1 株式会社ケイ・アイ研究所内 Shizuoka (JP). 船生明 (FUNYU, Akira) [JP/JP]; 〒4371213 静岡県磐田市塩新田 4 0 8 番地の 1 株式会社ケイ・アイ研究所内 Shizuoka (JP). 小林方美 (KOBAYASHI, Masami) [JP/JP]; 〒1108782 東京都台東区池之端 1 丁目 4 番 2 6 号クミアイ化学工業株式会社内 Tokyo (JP). 光成崇 (MITSUNARI, Takashi) [JP/JP]; 〒1108782 東京都台東区池之端 1 丁目 4 番 2 6 号クミアイ化学工業株式会社内 Tokyo (JP).

- (74) 代理人: 佐伯憲生 (SAEKI, Norio); 〒1030027 東京都中央区日本橋三丁目 1 5 番 8 号アミノ酸会館ビル 4 階 Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, 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, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ,

[続葉有]

(54) Title: RING-FUSED 2-PYRIDONE DERIVATIVES AND HERBICIDES

(54) 発明の名称: 縮合環化した 2-ピリドン誘導体及び除草剤



[I]

(57) Abstract: Provided are 2-pyridone derivatives which have excellent herbicidal activity and exhibit high safety to useful crops and so on; salts thereof; and herbicides containing same. In more detail, 2-pyridone derivatives represented by general formula [I] or agrochemically acceptable salts thereof, and herbicides containing these compounds are provided. In general formula [I], X¹ is an oxygen atom or a sulfur atom; X², X³, and X⁴ are each CH or N(O)_m; m is an integer of 0 or 1; R¹ is a hydrogen atom, a C₁₋₁₂ alkyl group, or the like; R² is a halogen atom, a cyano group, or the like; n is an integer of 0 to 4; R³ is a hydroxyl group, a halogen atom, or the like; A¹ is C(R¹¹R¹²); A² is C(R¹³R¹⁴) or C=O; A³ is C(R¹⁵R¹⁶); and R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, and R¹⁶ are each independently a hydrogen atom or a C₁₋₆ alkyl group.

(57) 要約: 本発明は、優れた除草活性を有し、更に有用作物等に対して高い安全性を示す 2-ピリドン誘導体又はその塩、及び、それを含有してなる除草剤を提供する。

[続葉有]

WO 2010/089993 A1



NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア
(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ
(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, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ,

CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN,
TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))

本発明は、下記一般式 [I] {式中、 X^1 は酸素原子又は硫黄原子を表し、 X^2 、 X^3 及び X^4 はCH又はN(O)_mを表し、mは0又は1の整数を表し、 R^1 は水素原子又はC₁~C₁₂アルキル基等を表し、 R^2 はハロゲン原子又はシアノ基等を表し、nは0~4の整数を表し、 R^3 はヒドロキシル基又はハロゲン原子等を表し、 A^1 はC($R^{11}R^{12}$)を表し、 A^2 はC($R^{13}R^{14}$)又はC=Oを表し、 A^3 はC($R^{15}R^{16}$)を表し、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 及び R^{16} は互いに独立して、水素原子又はC₁~C₆アルキル基を表す。}で表される2-ピリドン誘導体又はその農業上許容される塩、これらの化合物を含有してなる除草剤に関する。

明 細 書

発明の名称：縮合環化した２－ピリドン誘導体及び除草剤

技術分野

[0001] 本発明は、新規な縮合環化した２－ピリドン誘導体又はその塩、並びにこれらを有効成分として含有する除草剤及びその使用方法に関する。

背景技術

[0002] ２位がアリールカルボニル基でアシル化された１，３－シクロヘキサンジオン誘導体のなかのいくつかの化合物は既に農薬として市販されるに至っている。例えば、メソトリオンは、トウモロコシ用の茎葉処理型除草剤として注目されている。１，３－シクロヘキサンジオン環は、互変異性体として、そのエノール型である１－ヒドロキシシクロヘキセン－３－オンとしても存在し、この誘導体が各種の農薬用の化合物として開発されてきている。

[0003] 例えば、２位に置換するアリールカルボニル基のアリール基をチオフェンなどのヘテロアリールとしたもの（特許文献１参照）、１，３－シクロヘキサンジオン環の４、５位にシクロプロパン環を縮合させたもの（特許文献２参照）、２位のアリールカルボニル基をピリミジン－５－イルカルボニル基誘導体としたもの（特許文献３参照）、２位のアリールカルボニル基をピラジン－２－イルカルボニル基誘導体としたもの（特許文献４参照）、２位のアリールカルボニル基を１，２，３－チアジアゾール－５－イルカルボニル基誘導体としたもの（特許文献５参照）、２位のアリールカルボニル基をピリジンカルボニル基誘導体としたもの（特許文献２、６、７、８、９、及び１０参照）、２位のアリールカルボニル基をキノリンカルボニル基誘導体としたもの（特許文献１１、及び１２参照）、２位のアリールカルボニル基をベンズアゾール類からなるヘテロアリールカルボニル基誘導体としたもの（特許文献１３参照）、２位のアリールカルボニル基を１，２－アゾール類からなるアゾールカルボニル基誘導体としたもの（特許文献１４参照）、２位のアリールカルボニル基をピリドンカルボニル基誘導体としたもの（

特許文献15参照)などが報告されている。また、1, 3-シクロヘキサンジオン環の4位及び6位をエチレン基などのアルキレン基で架橋したのも報告されている(特許文献8、11、12、13、14、16、及び17参照)。さらに、5位に置換チオ基を導入した1, 3-シクロヘキサンジオン環を有するものも報告されている(特許文献18参照)。

[0004] このように、除草活性を有するシクロヘキサンジオン系化合物が多数報告されてきているが、後記式[I]で表される本発明の化合物のように、オキソ基又はチオキソ基(本明細書では、これらを総称して(チオ)オキソということもある。)が置換したジヒドロピラジン環を有するシクロヘキサンジオン系化合物は知られていない。

先行技術文献

特許文献

- [0005] 特許文献1: 欧州特許公開公報 EP-283261号公報
特許文献2: WO 91/00260号公報
特許文献3: USP 4708732号明細書
特許文献4: 欧州特許公開公報 DE-3902818号公報
特許文献5: 欧州特許公開公報 EP-338525号公報
特許文献6: 特開平2-78662号公報
特許文献7: 特開平3-52862号公報
特許文献8: 特開平4-29973号公報
特許文献9: WO 96/14285号公報
特許文献10: WO 2000/39094号公報
特許文献11: 特開2000-16982号公報
特許文献12: WO 2000/14069号公報
特許文献13: WO 2000/68210号公報
特許文献14: 特開2005-200401号公報
特許文献15: WO 2007/088876号公報
特許文献16: WO 2005/058831号公報

特許文献17：WO 2006/066871号公報

特許文献18：DE 10256354号公報

発明の概要

発明が解決しようとする課題

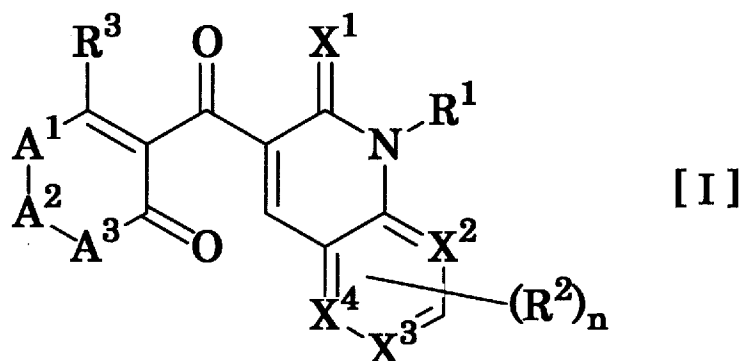
- [0006] 上記のように特定のヘテロアリールカルボニル基で置換された1, 3-シクロヘキサンジオン系化合物が除草活性を有することが知られているが、これらの化合物は高い薬量を必要とするため除草剤として満足できるものではなく、より低薬量で優れた特性を備えた除草剤の創出が求められていた。
- [0007] 本発明は、上記事情に鑑みてなされたものであって、その目的とするところは、有用植物、有用作物に対して薬害がなく、畑地、果樹園、水田、非農耕地に発生する種々の雑草を低薬量で防除できる除草活性を有する化合物、それを含有してなる除草剤を提供することにある。

課題を解決するための手段

- [0008] 本発明者らは、上記の目的を達成するために、シクロヘキサンジオン系化合物における化学構造と除草活性について鋭意研究を行ってきた。その結果、オキソ基又はチオキソ基が置換した2-ピリドン環を有するシクロヘキサンジオン系化合物が畑地、果樹園、水田、非農耕地に発生する種々の雑草を長期間防除することができ、さらに有用植物、有用作物などに対して高い安全性を示すことを見出し、本発明を完成するに至った。
- [0009] 即ち、本発明は、除草活性を有する2-ヘテロアリールカルボニル-1, 3-シクロヘキサンジオン系化合物において、ヘテロアリール基として置換基を有してもよい2-(チオ)オキソキノリン-3-イル基、置換基を有してもよい2-(チオ)オキソ-1, 8-ナフチリジン-3-イル基、置換基を有してもよい2-(チオ)オキソ-1, 5-ナフチリジン-3-イル基又は置換基を有してもよい7-(チオ)オキソピリド[2, 3-d]ピリミジン-6-イル基を用いることを特徴とするものである。
- [0010] より詳細には、本発明は、次の(1)に関するものである。

(1) 一般式 [I]

[0011] [化1]

[0012] {式中、X¹は、酸素原子又は硫黄原子を表し、X²、X³及びX⁴は、CH（当該炭素原子はR²により置換されてもよい。）；又はN（O）_mを表し、

mは、0又は1の整数を表し、

R¹は、水素原子；C₁～C₁₂アルキル基；C₂～C₆アルケニル基；C₂～C₆アルキニル基；C₃～C₈シクロアルキル基；C₃～C₈シクロアルキルC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆ハロアルキル基；C₂～C₆ハロアルケニル基；C₂～C₆ハロアルキニル基；C₃～C₈ハロシクロアルキル基；C₃～C₈ハロシクロアルキルC₁～C₆アルキル基；アミノC₁～C₆アルキル基；ニトロC₁～C₆アルキル基；モノ（C₁～C₆アルキル）アミノC₁～C₆アルキル基；ジ（C₁～C₆アルキル）アミノC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆アルキルチオC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆アルキルスルフィニルC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆アルキルスルホニルC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆ハロアルキルチオC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆ハロアルキルスルフィニルC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆ハロアルキルスルホニルC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基；ヒドロキシC₁～C₆アルキル基；フェニルC₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基（該基のフェニルは、1又は2～5個の同一もしくは異なるR⁴により置換されてもよい。）；C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基；C₃～C₈シクロアルキルオキシC₁～C₆アルキル基；C₃～C₈シクロアルキルC₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基；

フェニルオキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基（該基のフェニルは、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^4 により置換されてもよい。）；酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環オキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基（該基の酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環は、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^5 により置換されてもよい。）；フェニルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基（該基のフェニルは、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^4 により置換されてもよい。）；フェニルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基（該基のフェニルは、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^4 により置換されてもよい。）；フェニルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基（該基のフェニルは、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^4 により置換されてもよい。）； $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基；酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基（該基の酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環は、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^5 により置換されてもよい。）； $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基；シアノ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基；シアノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アシル $C_1 \sim C_6$ アルキル基；ジ（ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ） $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシイミノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミノオキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基；（ $R^6R^7N-C=O$ ） $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_6 \sim C_{10}$ アリール $C_1 \sim C_6$ アルキル基（該基のアリールは、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^4 により置換されてもよい。）；酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の

複素環 $C_1 \sim C_6$ アルキル基（該基の酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される 1 ～ 5 個のヘテロ原子を有する炭素数 2 ～ 10 の複素環は、1 又は 2 ～ 5 個の同一もしくは異なる R^5 により置換されてもよい。）； NR^8R^9 基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_6 \sim C_{10}$ アリール基（該基は 1 又は 2 ～ 5 個の同一もしくは異なる R^4 により置換されてもよい。）；又は、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される 1 ～ 5 個のヘテロ原子を有する炭素数 2 ～ 10 の複素環基（該基は、1 又は 2 ～ 5 個の同一もしくは異なる R^5 により置換されてもよい。）を表し、

R^2 は、ハロゲン原子；ヒドロキシル基；ニトロ基；シアノ基； $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基； $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_2 \sim C_6$ アルケニル基； $C_2 \sim C_6$ アルキニル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基； $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基； $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル基； $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル基； $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルオキシ基； $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルキルオキシ基； $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ基； $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ基； $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル基；アミノ基；モノ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノ基；ジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノ基； $C_1 \sim C_6$ アシルアミノ基；ヒドロキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基；シアノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アシル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシイミノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基；カルボキシル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニ

ル基；カルバモイル基；モノ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノカルボニル基；ジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノカルボニル基；又は、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環基（該基の酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環は、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。）を表し、

また、 R^2 は、隣接した2個の R^2 が一緒になって、それぞれの R^2 が直接結合している炭素原子と共に、炭素環又は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～4個のヘテロ原子を有する複素環である4～8員環を形成してもよく、このときに形成された環はハロゲン原子；シアノ基；ニトロ基； $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基；又はオキソ基で置換されてもよく、

n は、 X^2 、 X^3 及び X^4 がCH（該炭素原子は R^2 により置換されてもよい。））、即ち、置換基 R^2 により置換されてもよいCHである場合は0～4の整数を表し、

R^3 は、ヒドロキシル基； O^-M^+ （ M^+ はアルカリ金属カチオン又はアンモニウムカチオンを示す。）；アミノ基；ハロゲン原子； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ基； $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル基； $C_2 \sim C_6$ アルケニルチオ基； $C_2 \sim C_6$ アルケニルスルフィニル基； $C_2 \sim C_6$ アルケニルスルホニル基； $C_2 \sim C_6$ アルキニルチオ基； $C_2 \sim C_6$ アルキニルスルフィニル基； $C_2 \sim C_6$ アルキニルスルホニル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ基； $C_2 \sim C_6$ アルケニルカルボニルオキシ基； $C_2 \sim C_6$ アルキニルカルボニルオキシ基；フェノキシ基（該基は、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。）；フェニルチオ基（該基は、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。）；フェニルスルフィニル基（該基は、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^{10} により

置換されてもよい。) ; フェニルスルホニル基 (該基は、1 又は 2 ~ 5 個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。) ; フェニルスルホニルオキシ基 (該基は、1 又は 2 ~ 5 個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。) ; フェニルカルボニルオキシ基 (該基は、1 又は 2 ~ 5 個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。) ; 1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基; 1, 2, 3-トリアゾール-1-イル基; 1, 2, 3-トリアゾール-2-イル基; イミダゾール-1-イル基; ピラゾール-1-イル基; テトラゾール-1-イル基; 又はテトラゾール-2-イル基を表し、

R^4 は、ハロゲン原子; ヒドロキシ基; ニトロ基; シアノ基; $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基; $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_2 \sim C_6$ アルケニル基; $C_2 \sim C_6$ アルキニル基; $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基; $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基; $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル基; $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル基; $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基; $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルオキシ基; $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ基; $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ基; $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ基; $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基; $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基; $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル基; $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基; $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ基; $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル基; $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル基; アミノ基; $C_1 \sim C_6$ アシルアミノ基; モノ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ基; ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ基; ヒドロキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基; シアノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基; $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルキルオキシ基; $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ $C_1 \sim C_6$ アル

コキシ基；シアノ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_1 \sim C_6$ アシル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシイミノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基；カルボキシル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル基；カルバモイル基；モノ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノカルボニル基；ジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノカルボニル基；酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される 1～5 個のヘテロ原子を有する炭素数 2～10 の複素環基（該基の複素環は、1 又は 2～5 個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。）；又は、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より任意に選択される 1～5 個のヘテロ原子を有する炭素数 2～10 の複素環オキシ基

（該基の酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択さ

れる 1～5 個のヘテロ原子を有する炭素数 2～10 の複素環は、1 又は 2～5 個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。）を表し、

また、 R^4 は、隣接した 2 個の R^4 が一緒になって、それぞれの R^4 が直接結合している炭素原子と共に、炭素環又は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される 1～4 個のヘテロ原子を有する複素環である 4～8 員環を形成してもよく、このときに形成された環はハロゲン原子；シアノ基；ニトロ基； $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基；又はオキソ基で置換されてもよく、

R^5 は、オキソ基；チオキソ基；ヒドロキシル基；ハロゲン原子；ニトロ基；シアノ基； $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_2 \sim C_6$ アルケニル基； $C_2 \sim C_6$ アルキニル基； $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基； $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基； $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基； $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル基； $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ基； $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ基； $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルオキシ基； $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルキルオキシ基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基；シアノ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ基； $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基

; $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ基; $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル基; $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル基; アミノ基; モノ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ基; ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ基; $C_1 \sim C_6$ アシルアミノ基; カルボキシ基; $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル基; カルバモイル基; モノ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル基; ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル基; $C_1 \sim C_6$ アシル基; $C_1 \sim C_6$ アルコキシイミノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基; 又はシアノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表し、

また、 R^5 は、隣接した2個の R^5 が一緒になって、それぞれの R^5 が直接結合している炭素原子と共に、炭素環又は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～4個のヘテロ原子を有する複素環である4～8員環を形成してもよく、このときに形成された環はハロゲン原子; シアノ基; ニトロ基; $C_1 \sim C_6$ アルキル基; $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基; $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基; $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基; 又はオキソ基で置換されてもよく、

R^6 及び R^7 は、互いに独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基; 又はフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルオキシカルボニル基を表し、

また、 R^6 及び R^7 は、これらが一緒になってこれらが結合している窒素原子と共に5～6員環を形成していてもよく、このときに形成された環中に R^6 及び R^7 が結合している窒素原子以外に酸素原子が介在していてもよく、

R^8 及び R^9 は、互いに独立して、水素原子; $C_1 \sim C_6$ アルキル基; NR^6R^7 基; 又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル基を表し、

また、 R^8 及び R^9 は、これらが一緒になってこれらが結合している窒素原子と共に5～6員環を形成していてもよく、この際、この環中に R^8 及び R^9 が結合している窒素原子以外に硫黄原子及び／又は酸素原子が介在していても

よく、

R^{10} は、ハロゲン原子；ニトロ基；シアノ基； $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基；又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基を表し、

A^1 は、 $C(R^{11}R^{12})$ を表し、

A^2 は、 $C(R^{13}R^{14})$ 、又は $C=O$ を表し、

A^3 は、 $C(R^{15}R^{16})$ を表し、

R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 及び R^{16} は、互いに独立して、水素原子；又は $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表し、

また、 R^{11} と R^{16} はこれらが一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成し、隣接する炭素原子と共に環を構成しても良い。}

で表される2-ピリドン誘導体又はその農薬上許容される塩。

(2) 前記(1)に記載の2-ピリドン誘導体又はその塩を活性成分として含有することを特徴とする除草剤。

(3) 前記(2)に記載の除草剤の有効量を土壌及び／又は植物に処理することを特徴とする除草剤の使用。

(4) 前記(2)に記載の除草剤の有効量を土壌及び／又は植物に処理することを特徴とする除草方法。

発明の効果

[0013] 本発明の一般式[I]で表される2-ピリドン誘導体又はその農薬上許容される塩は、畑地、果樹園、水田、非農耕地に発生する種々の雑草を防除することができ、さらに有用植物、有用作物などに対して高い安全性を示すなど、農薬として優れた作用効果を有するものである。

発明を実施するための最良の形態

[0014] 本明細書に記載された記号及び用語について説明する。

[0015] ハロゲン原子とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子である。

[0016] $C_1 \sim C_3$ のような元素記号と下付きの数字による表記は、これに続いて表

記されている基の元素数が下付きの数字で示される範囲であることを示している。例えば、この場合では炭素数が1～3であることを示しており、 $C_1 \sim C_6$ の表記では、炭素数が1～6であることを示しており、 $C_1 \sim C_{12}$ の表記では、炭素数が1～12であることを示している。

また、アルキル基、アルケニル基などの炭素鎖による基の命名においては、特に指定がない場合には、ノルマル（ n －）であることを示す。

[0017] $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、炭素数が1～6の直鎖又は分岐鎖状のアルキル基を示し、例えばメチル、エチル、 n －プロピル、イソプロピル、 n －ブチル、 sec －ブチル、イソブチル、 $tert$ －ブチル、 n －ペンチル、1－メチルブチル、2－メチルブチル、3－メチルブチル、1－エチルプロピル、1, 1－ジメチルプロピル、1, 2－ジメチルプロピル、ネオペンチル、 n －ヘキシル、1－メチルペンチル、2－メチルペンチル、3－メチルペンチル、4－メチルペンチル、1－エチルブチル、2－エチルブチル、1, 1－ジメチルブチル、1, 2－ジメチルブチル、1, 3－ジメチルブチル、2, 2－ジメチルブチル、2, 3－ジメチルブチル、3, 3－ジメチルブチル、1, 1, 2－トリメチルプロピル、1, 2, 2－トリメチルプロピル、1－エチル－1－メチルプロピル、1－エチル－2－メチルプロピル等の基を挙げることができる。炭素数1～6の好ましいアルキル基としては、炭素数1～4、又は1～3の直鎖又は分岐鎖状のアルキル基が挙げられる。

[0018] $C_1 \sim C_{12}$ アルキル基とは、特に限定しない限り、炭素数が1～12の直鎖又は分岐鎖状のアルキル基を示し、例えば上記に示した $C_1 \sim C_6$ アルキル基の例示に加え、 n －ヘプチル、1－メチルヘキシル、5－メチルヘキシル、1, 1－ジメチルペンチル、2, 2－ジメチルペンチル、4, 4－ジメチルペンチル、1－エチルペンチル、2－エチルペンチル、1, 1, 3－トリメチルブチル、1, 2, 2－トリメチルブチル、1, 3, 3－トリメチルブチル、2, 2, 3－トリメチルブチル、2, 3, 3－トリメチルブチル、1－プロピルブチル、1, 1, 2, 2－テトラメチルプロピル、 n －オクチル、

1-メチルヘプチル、3-メチルヘプチル、6-メチルヘプチル、2-エチルヘキシル、5, 5-ジメチルヘキシル、2, 4, 4-トリメチルペンチル、1-エチル-1-メチルペンチル、ノニル、1-メチルオクチル、2-メチルオクチル、3-メチルオクチル、7-メチルオクチル、1-エチルヘプチル基、1, 1-ジメチルヘプチル、6, 6-ジメチルヘプチル、デシル、1-メチルノニル、2-メチルノニル、6-メチルノニル、1-エチルオクチル、1-プロピルヘプチル、n-ノニル、n-デシル、n-ウンデシル、n-ドデシル等の基を挙げることができる。炭素数1~12の好ましいアルキル基としては、炭素数1~8、1~6、又は1~3の直鎖又は分岐鎖状のアルキル基が挙げられる。

[0019] $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基とは、特に限定しない限り、炭素数が3~8のシクロアルキル基を示し、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル等の基を挙げることができる。炭素数3~8の好ましいシクロアルキル基としては、炭素数3~6、又は4~6のシクロアルキル基が挙げられる。

[0020] $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、シクロアルキル部分及びアルキル部分が上記の意味である炭素数が3~8のシクロアルキルにより置換された炭素数が1~6のアルキル基を示し、例えばシクロプロピルメチル、1-シクロプロピルエチル、2-シクロプロピルエチル、1-シクロプロピルプロピル、2-シクロプロピルプロピル、3-シクロプロピルプロピル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル等の基をあげることができる。

[0021] $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基とは、1個以上、好ましくは1~10個、より好ましくは1~5個のハロゲン原子によって置換された炭素数が1~6の直鎖又は分岐鎖状のアルキル基を示し、例えばフルオロメチル、クロロメチル、ブromoメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ブromोजフルオロメチル、2-フルオロエチル、1-クロロエチル、2-クロロエチル、1-ブromoエチ

ル、2-ブromoエチル、2, 2-ジフルオロエチル、1, 2-ジクロロエチル、2, 2-ジクロロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、2-ブromo-2-クロロエチル、2-クロロ-1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロプロピル、2-クロロプロピル、3-クロロプロピル、2-ブromoプロピル、3-ブromoプロピル、2-ブromo-1-メチルエチル、3-ヨードプロピル、2, 3-ジクロロプロピル、2, 3-ジブromoプロピル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、3, 3, 3-トリクロロプロピル、3-ブromo-3, 3-ジフルオロプロピル、3, 3-ジクロロ-3-フルオロプロピル、2, 2, 3, 3-テトラフルオロプロピル、1-ブromo-3, 3, 3-トリフルオロプロピル、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロピル、2, 2, 2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチルエチル、ヘプタフルオロプロピル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-トリフルオロメチルエチル、2, 3-ジクロロ-1, 1, 2, 3, 3-ペンタフルオロプロピル、2-クロロブチル、3-クロロブチル、4-クロロブチル、2-クロロ-1, 1-ジメチルエチル、4-ブromoブチル、3-ブromo-2-メチルプロピル、2-ブromo-1, 1-ジメチルエチル、2, 2-ジクロロ-1, 1-ジメチルエチル、2-クロロ-1-クロロメチル-2-メチルエチル、4, 4, 4-トリフルオロブチル、3, 3, 3-トリフルオロ-1-メチルプロピル、3, 3, 3-トリフルオロ-2-メチルプロピル、2, 3, 4-トリクロロブチル、2, 2, 2-トリクロロ-1, 1-ジメチルエチル、4-クロロ-4, 4-ジフルオロブチル、4, 4-ジクロロ-4-フルオロブチル、4-ブromo-4, 4-ジフルオロブチル、2, 4-ジブromo-4, 4-ジフルオロブチル、3, 4-ジクロロ-3, 4, 4-トリフルオロブチル、3, 3-ジクロロ-4, 4, 4-トリフルオロブチル、4-ブromo-3, 3, 4, 4-テトラフルオロブチル、4-ブromo-3-クロロ-3, 4, 4-トリフルオロブチル、2, 2, 3, 3, 4, 4-ヘキサフルオロブチル

ル、2, 2, 3, 4, 4, 4-ヘキサフルオロブチル、2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチル-1-トリフルオロメチルエチル、3, 3, 3-トリフルオロ-2-トリフルオロメチルプロピル、2, 2, 3, 3, 4, 4, 4-ヘプタフルオロブチル、2, 3, 3, 3-テトラフルオロ-2-トリフルオロメチルプロピル、1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4-オクタフルオロブチル、ノナフルオロブチル、4-クロロ-1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4-オクタフルオロブチル、5-フルオロペンチル、5-クロロペンチル、5, 5-ジフルオロペンチル、5, 5-ジクロロペンチル、5, 5, 5-トリフルオロペンチル、6, 6, 6-トリフルオロヘキシル基、5, 5, 6, 6, 6-ペンタフルオロヘキシル等の基を挙げることができる。

[0022] $C_2 \sim C_6$ アルケニル基とは、特に限定しない限り、炭素数が2~6の直鎖又は分岐鎖状のアルケニル基を示し、例えばビニル、1-プロペニル、イソプロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-ブテニル、1-メチル-2-プロペニル、3-ブテニル、2-メチル-1-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1, 3-ブタジエニル、1-ペンテニル、1-エチル-2-プロペニル、2-ペンテニル、1-メチル-1-ブテニル、3-ペンテニル、1-メチル-2-ブテニル、4-ペンテニル、1-メチル-3-ブテニル、3-メチル-1-ブテニル、1, 2-ジメチル-2-プロペニル、1, 1-ジメチル-2-プロペニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1, 2-ジメチル-1-プロペニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1, 3-ペンタジエニル、1-ビニル-2-プロペニル、1-ヘキセニル、1-プロピル-2-プロペニル、2-ヘキセニル、1-メチル-1-ペンテニル、1-エチル-2-ブテニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-4-ペンテニル、1-エチル-3-ブテニル、1-（イソブチル）ビニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、1-エチル-2-メチル-2-プロペニル、1-（イソプロピル）-2-プロペニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-

3-ペンテニル、1, 3-ジメチル-2-ブテニル、1, 1-ジメチル-3-ブテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1, 2-ジメチル-3-ブテニル、1, 3-ジメチル-3-ブテニル、1, 1, 2-トリメチル-2-プロペニル、1, 5-ヘキサジエニル、1-ビニル-3-ブテニル、2, 4-ヘキサジエニル等の基を挙げることができる。炭素数2～6の好ましいアルケニル基としては、炭素数2～4の直鎖又は分岐鎖状のアルケニル基が挙げられる。

[0023] $C_2 \sim C_6$ アルキニル基とは、特に限定しない限り、炭素数が2～6の直鎖又は分岐鎖状のアルキニル基を示し、例えばエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-ペンチニル、1-エチル-2-プロピニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、1-メチル-2-ブチニル、4-ペンチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1-ヘキシニル、1-(n -プロピル)-2-プロピニル、2-ヘキシニル、1-エチル-2-ブチニル、3-ヘキシニル、1-メチル-2-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、4-メチル-1-ペンチニル、3-メチル-1-ペンチニル、5-ヘキシニル、1-エチル-3-ブチニル、1-エチル-1-メチル-2-プロピニル、1-(イソプロピル)-2-プロピニル、1, 1-ジメチル-2-ブチニル、2, 2-ジメチル-3-ブチニル等の基を挙げることができる。炭素数2～6の好ましいアルキニル基としては、炭素数2～4の直鎖又は分岐鎖状のアルキニル基が挙げられる。

[0024] $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基とは、特に限定しない限り炭素数が1～6の直鎖又は分岐鎖状のアルコキシ基を示し、例えばメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ等の基を挙げることができる。炭素数1～6の好ましいアルコキシ基としては、炭素数1～4、又は1～3の直鎖又は分岐鎖状のアルコキシ基が挙げられる。

[0025] $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、アルキル部分及びアルコキシ部分が前記の意味を有する炭素数が1～6のアルコキシにより置換された

炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばメトキシメチル、エトキシメチル、イソプロポキシメチル、ペンチルオキシメチル、メトキシエチル、ブトキシエチル等の基を挙げることができる。

[0026] $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基とは、アルコキシ部分が前記の意味を有する、炭素数が1～6のアルコキシにより置換された炭素数が1～6のアルコキシ基を示し、例えば、メトキシメトキシ、エトキシメトキシ、2-メトキシエトキシ、2-エトキシエトキシ等の基を挙げることができる。

[0027] $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルキルオキシ基とは、シクロアルキル部分及びアルキル部分が上記の意味である炭素数が3～8のシクロアルキルにより置換された炭素数が1～6の（アルキル）-O-基を示し、例えばシクロプロピルメチルオキシ、シクロプロピルエチルオキシ、シクロペンチルメチルオキシ等の基を挙げることができる。炭素数3～8の好ましいシクロアルキル基としては、炭素数3～6のシクロアルキル基が挙げられる。

[0028] シアノ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基とは、アルコキシ部分が前記の意味を有する、シアノ基により置換された炭素数が1～6のアルコキシ基を示し、例えば2-シアノエトキシ、3-シアノプロポキシ等の基を挙げることができる。

[0029] $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルオキシ基とは、特に限定しない限り、シクロアルキル部分が上記の意味である炭素数が3～8の（シクロアルキル）-O-基を示し、例えばシクロプロピルオキシ、シクロブチルオキシ、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシ等の基を挙げることができる。

[0030] $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ基とは、特に限定しない限り、アルケニル部分が上記の意味である炭素数が2～6の（アルケニル）-O-基を示し、例えば2-プロペニルオキシ等の基を挙げることができる。

[0031] $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ基とは、特に限定しない限り、アルキニル部分が上記の意味である炭素数が2～6の（アルキニル）-O-基を示し、例えば2-プロピニルオキシ等の基を挙げることができる。

[0032] $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基とは、アルキル部分が上記の意味である炭素数が

1～6の（アルキル）－S－基を示し、例えばメチルチオ、エチルチオ、n－プロピルチオ、イソプロピルチオ等の基を挙げることができる。

[0033] C₁～C₆アルキルスルフィニル基とは、アルキル部分が上記の意味である炭素数が1～6の（アルキル）－SO－基を示し、例えばメチルスルフィニル、エチルスルフィニル、n－プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル等の基を挙げることができる。

[0034] C₁～C₆アルキルスルホニル基とは、アルキル部分が上記の意味である炭素数が1～6の（アルキル）－SO₂－基を示し、例えばメチルスルホニル、エチルスルホニル、n－プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル等の基を挙げることができる。

[0035] C₁～C₆アルキルスルホニルオキシ基とは、アルキル部分が上記の意味である炭素数が1～6の（アルキル）SO₂－O－基を示し、例えばメチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ等の基を挙げることができる。

[0036] モノ（C₁～C₆アルキル）アミノ基とは、アルキル部分が上記の意味である炭素数が1～6の（アルキル）－NH－基を示し、例えばメチルアミノ、エチルアミノ等の基を挙げることができる。

[0037] ジ（C₁～C₆アルキル）アミノ基とは、アルキル部分が上記の意味である炭素数が1～6の（アルキル）₂N－基を示し、例えばジメチルアミノ、ジエチルアミノ、メチルエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジブチルアミノ等の基を挙げることができる。

[0038] モノ（C₁～C₆アルキル）アミノカルボニル基とは、アルキル部分が上記の意味である炭素数が1～6の（アルキル）－NH－C（＝O）－基を示し、例えばメチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル等の基を挙げることができる。

[0039] ジ（C₁～C₆アルキル）アミノカルボニル基とは、アルキル部分が上記の意味である炭素数が1～6の（アルキル）₂N－C（＝O）－基を示し、例えばジメチルアミノカルボニル、ジエチルアミノカルボニル、メチルエチルアミノカルボニル、ジプロピルアミノカルボニル、ジブチルアミノカルボニル

等の基を挙げることができる。

- [0040] $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル基とは、アルキル部分が上記の意味である炭素数が1～6の（アルキル） $-O-C(=O)-$ 基を示し、例えばメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、 n -プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル等の基を挙げることができる。
- [0041] $C_1 \sim C_6$ アシル基とは、炭素数1～6の直鎖又は分岐鎖状の脂肪族カルボン酸から誘導されるアシル基を示し、脂肪族基がアルキル基の場合にはアルキルカルボニル基ということもでき、例えばホルミル、アセチル、プロピオニル、イソプロピオニル、ブチリル、ピバロイル等の基を挙げることができる。
- [0042] $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ基とは、アルキル部分が上記の意味である炭素数が1～6の（アルキル） $-C(=O)-O-$ 基を示し、例えばアセトキシ、プロピオニルオキシ、イソプロピオニルオキシ、ピバロイルオキシ等の基を挙げることができる。
- [0043] $C_2 \sim C_6$ アルケニルカルボニルオキシ基とは、アルケニル部分が上記の意味である炭素数が2～6の（アルケニル） $-C(=O)-O-$ 基を示し、例えば、1-プロペニルカルボニルオキシ、2-プロペニルカルボニルオキシ、1-ブテニルカルボニルオキシ、1-メチルー1-プロペニルカルボニルオキシ等の基を挙げることができる。
- [0044] $C_2 \sim C_6$ アルキニルカルボニルオキシ基とは、アルキニル部分が上記の意味である炭素数が2～6の（アルキニル） $-C(=O)-O-$ 基を示し、例えば、1-プロピニルカルボニルオキシ、2-プロピニルカルボニルオキシ等の基を挙げることができる。
- [0045] $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ基とは、ハロアルキル部分が上記の意味である炭素数が1～6の（ハロアルキル） $-S-$ 基を示し、例えば、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ等の基を挙げることができる。
- [0046] $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル基とは、ハロアルキル部分が上記の意味である炭素数が1～6の（ハロアルキル） $-S-O-$ 基を示し、例えばクロ

ロメチルスルフィニル、ジフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル等の基を挙げることができる。

[0047] $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル基とは、ハロアルキル部分が上記の意味である炭素数が1～6の（ハロアルキル） $-SO_2-$ 基を示し、例えばクロロメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル等の基を挙げることができる。

[0048] モノ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノカルボニル基とは、アルキル部分が上記の意味である炭素数が1～6の（アルキル） $NH-C(=O)-$ 基を示し、例えばメチルアミノカルボニル又はエチルアミノカルボニル等の基を挙げることができる。

[0049] ジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノカルボニル基とは、アルキル部分が上記の意味である（アルキル） $_2N-C(=O)-$ 基を示し、例えばジメチルアミノカルボニル、ジエチルアミノカルボニル、メチルエチルアミノカルボニル、ジプロピルアミノカルボニル、ジブチルアミノカルボニル等の基を挙げることができる。

[0050] $C_2 \sim C_6$ アルケニルチオ基とは、アルケニル部分が上記の意味である炭素数が2～6の（アルケニル） $-S-$ 基を示し、例えばアリルチオ等の基を挙げることができる。

[0051] $C_2 \sim C_6$ アルケニルスルフィニル基とは、アルケニル部分が上記の意味である炭素数が3～6の（アルケニル） $-SO-$ 基を示し、例えばアリルスルフィニル等の基を挙げることができる。

[0052] $C_2 \sim C_6$ アルケニルスルホニル基とは、アルケニル部分が上記の意味である炭素数が2～6の（アルケニル） $-SO_2-$ 基を示し、例えばアリルスルホニル等の基を挙げることができる。

[0053] $C_2 \sim C_6$ アルキニルチオ基とは、アルキニル部分が上記の意味である炭素数が2～6の（アルキニル） $-S-$ 基を示し、例えば2-プロピニルチオ等の基を挙げることができる。

[0054] $C_2 \sim C_6$ アルキニルスルフィニル基とは、アルキニル部分が上記の意味で

ある炭素数が2～6の（アルキニル）－SO－基を示し、例えば2－プロピニルスルフィニル等の基を挙げることができる。

[0055] $C_2 \sim C_6$ アルキニルスルホニル基とは、アルキニル部分が上記の意味である炭素数が2～6の（アルキニル）－SO₂－基を示し、例えば2－プロピニルスルホニル等の基を挙げることができる。

[0056] 酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環基とは、特に限定しない限り、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子からなる群から選択される1～5個、好ましくは1～3個のヘテロ原子を有する3～8員、好ましくは5～7員の単環式、多環式、又は縮合環式の複素環からなる1価の基であって、例えば、オキシラン、テトラヒドロフラン、ピロリジン、テトラヒドロチオフェン、テトラヒドロチオフェンジオキサイド、テトラヒドロチオピラン、テトラヒドロチオピランジオキサイド、4, 5－ジヒドロイソオキサゾール、ピペリジン、ピペラジン、モルホリン、フラン、チオフェン、ピロール、ピラゾール、イミダゾール、オキサゾール、イソオキサゾール、チアゾール、イソチアゾール、1, 3, 4－オキサジアゾール、1, 3, 4－チアジアゾール、1, 3, 4－トリアゾール、1, 2, 4－オキサジアゾール、1, 2, 4－チアジアゾール、1, 2, 4－トリアゾール、1, 2, 3－オキサジアゾール、1, 2, 3－チアジアゾール、1, 2, 3－トリアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン、1, 3, 5－トリアジン、1, 2, 4－トリアジン、ベンゾチオフェン、ベンゾフラン、インドール、ベンゾオキサゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾイミダゾール、ベンゾイソオキサゾール、ベンゾイソチアゾール、インダゾール、1, 3－ベンゾジオキサソール、ベンゾ－1, 4－ジオキサン、2, 3－ジヒドロベンゾフラン等の基を挙げることができる。

[0057] 酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環 $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分に前記の意味を有する複素環が置換した炭素数が1～6の

アルキル基を示し、例えば（テトラヒドロフランー２－イル）メチル、（４，５－ジヒドロイソキサゾールー５－イル）メチル、（イソキサゾールー５－イル）メチル、（チオフェンー２－イル）メチル基等を挙げることができる。

[0058] 酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より任意に選択される１～５個のヘテロ原子を有する炭素数２～１０の複素環オキシ基とは、特に限定しない限り酸素原子に前記の意味を有する複素環が置換した基を示し例えば（テトラヒドロフランー２－イル）オキシ、（４，５－ジヒドロイソキサゾールー５－イル）オキシ、（イソキサゾールー５－イル）オキシ、（チオフェンー２－イル）オキシ基等を挙げることができる。

[0059] 酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される１～５個のヘテロ原子を有する炭素数２～１０の複素環 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される１～５個のヘテロ原子を有する炭素数２～１０の複素環部分、アルコキシ部分及びアルキル部分が前記の意味を有する、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される１～５個のヘテロ原子を有する炭素数２～１０の複素環が置換した炭素数が１～６のアルコキシ基が置換した炭素数が１～６のアルキル基を示し、例えば（テトラヒドロフランー２－イル）メトキシメチル、（テトラヒドロフランー３－イル）メトキシメチル等の基を挙げることができる。

[0060] $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基とは、特に限定しない限り、同一又は異なって、ハロゲン原子１～１１個、好ましくは１～５個で置換されている炭素数が２～６の直鎖又は分岐鎖のアルケニル基を示し、例えば２－クロロビニル、２－ブロモビニル、２－ヨードビニル、３－クロロ－２－プロペニル、３－ブロモ－２－プロペニル、１－クロロメチルビニル、２－ブロモ－１－メチルビニル、１－トリフルオロメチルビニル、３，３，３－トリクロロ－１－プロペニル、３－ブロモ－３，３－ジフルオロ－１－プロペニル、２，３，３，３－テトラクロロ－１－プロペニル、１－トリフルオロメチルー２，２－ジフルオロビニル、２－クロロ－２－プロペニル、３，３－ジフルオロ－

2-プロペニル、2, 3, 3-トリクロロ-2-プロペニル、4-ブロモ-3-クロロ-3, 4, 4-トリフルオロ-1-ブテニル、1-ブロモメチル-2-プロペニル、3-クロロ-2-ブテニル、4, 4, 4-トリフルオロ-2-ブテニル、4-ブロモ-4, 4-ジフルオロ-2-ブテニル、3-ブロモ-3-ブテニル、3, 4, 4-トリフルオロ-3-ブテニル、3, 4, 4-トリブロモ-3-ブテニル、3-ブロモ-2-メチル-2-プロペニル、3, 3-ジフルオロ-2-メチル-2-プロペニル、3, 3, 3-トリフルオロ-2-メチルプロペニル、3-クロロ-4, 4, 4-トリフルオロ-2-ブテニル、3, 3, 3-トリフルオロ-1-メチル-1-プロペニル、3, 4, 4-トリフルオロ-1, 3-ブタジエニル、3, 4-ジブロモ-1-ペンテニル、4, 4-ジフルオロ-3-メチル-3-ブテニル、3, 3, 4, 4, 5, 5, 5-ヘプタフルオロ-1-ペンテニル、5, 5-ジフルオロ-4-ペンテニル、4, 5, 5-トリフルオロ-4-ペンテニル、3, 4, 4, 4-テトラフルオロ-3-トリフルオロメチル-1-ブテニル、4, 4, 4-トリフルオロメチル-3-メチル-2-ブテニル、3, 5, 5-トリフルオロ-2, 4-ペンタジエニル、4, 4, 5, 5, 6, 6, 6-ヘプタフルオロ-2-ヘキセニル、3, 4, 4, 5, 5, 5-ヘキサフルオロ-3-トリフルオロメチル-1-ペンテニル、4, 5, 5, 5-テトラフルオロ-4-トリフルオロメチル-2-ペンテニル又は5-ブロモ-4, 5, 5-トリフルオロ-4-トリフルオロメチル-2-ペンテニル等の基を挙げることができる。

[0061] $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル基とは、特に限定しない限り、同一又は異なって、ハロゲン原子1～4個で置換されている炭素数が2～6の直鎖又は分岐鎖のアルキニル基を示し、例えば、3-クロロ-2-プロピニル、3-ブロモ-2-プロピニル、3-ヨード-2-プロピニル、3-クロロ-1-プロピニル、5-クロロ-4-ペンチニル等の基を挙げることができる。

[0062] アミノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が前記の意味を有する、アミノ基により置換された炭素数が1～6のアルキル基

を示し、例えば2-アミノエチル、3-アミノプロピル等の基を挙げることができる。

[0063] モノ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が前記の意味を有するアルキル基でモノ置換されたアミノ基により置換された炭素数が1~6の直鎖又は分岐鎖のアルキル基を示し、例えば2-(メチルアミノ)エチル、3-(メチルアミノ)プロピル等の基を挙げることができる。

[0064] ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が前記の意味を有するアルキル基でジ置換されたアミノ基により置換された炭素数が1~6の直鎖又は分岐鎖のアルキル基を示し、例えばN、N-ジメチルアミノメチル、N、N-ジメチルアミノエチル等の基を挙げることができる。

[0065] $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分及びアルキルチオのアルキル部分が前記の意味を有する、炭素数が1~6のアルキルチオ基により置換された炭素数が1~6のアルキル基を示し、例えばメチルチオメチル又はエチルチオメチル等の基を挙げることができる。

[0066] $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分及びアルキルスルフィニルのアルキル部分が前記の意味を有する、炭素数が1~6のアルキルスルフィニル基により置換された炭素数が1~6のアルキル基を示し、例えばメチルスルフィニルメチル又はエチルスルフィニルメチル等の基を挙げることができる。

[0067] $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分及びアルキルスルホニルのアルキル部分が前記の意味を有する、炭素数が1~6のアルキルスルホニル基により置換された炭素数が1~6のアルキル基を示し、例えばメチルスルホニルメチル又はエチルスルホニルメチル等の基を挙げることができる。

[0068] $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り

、アルキル部分及びハロアルキル部分が上記の意味である、炭素数が1～6の（ハロアルキル）－S－基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えば、ジフルオロメチルチオメチル、トリフルオロメチルチオメチル等の基を挙げることができる。

[0069] $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分及びハロアルキル部分が上記の意味である、炭素数が1～6の（ハロアルキル）－SO－基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばジフルオロメチルスルフィニルメチル、トリフルオロメチルスルフィニルメチル等の基を挙げることができる。

[0070] $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分及びハロアルキル部分が上記の意味である、炭素数が1～6の（ハロアルキル）－SO₂－基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えば、ジフルオロメチルスルホニルメチル、トリフルオロメチルスルホニルメチル等の基を挙げることができる。

[0071] フェニル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分及びアルコキシ部分が上記の意味である、フェニルにより置換された炭素数が1～6のアルコキシ基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばベンジルオキシメチル又はベンジルオキシエチル等の基を挙げることができる。

フェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルオキシカルボニル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が上記の意味である、フェニルにより置換された炭素数が1～6の（アルキル）－O－CO－基を示し、例えばベンジルオキシカルボニル又はフェネチルオキシカルボニル等の基を挙げることができる。

[0072] $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分及びアルコキシ部分が前記の意味を有する、炭素数が1～6のアルコキシ基により置換された炭素数が1～6のアルコキシ基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えば2－（2－メトキシエトキシ）エチル又は2－（2－エトキシエトキシ）エチル等の基

を挙げることができる。

- [0073] $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルオキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分及びシクロアルキル部分が上記の意味である、炭素数が3～8の（シクロアルキル）－O－基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばシクロプロピルオキシメチル、シクロブチルオキシメチル、シクロペンチルオキシメチル又はシクロヘキシルオキシメチル等の基を挙げることができる。
- [0074] フェニルオキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が上記の意味である、（フェニル）－O－基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばフェノキシメチル、2－フェノキシエチル、3－フェノキシプロピル等の基を挙げることができる。
- [0075] フェニルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が上記の意味である、（フェニル）－S－基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばフェニルチオメチル、2－フェニルチオエチル、3－フェニルチオプロピル等の基を挙げることができる。
- [0076] $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基とは、特に限定しない限り、ハロアルキル部分が前記の意味を有する、同一又は相異なるハロゲン原子1～13個、好ましくは1～5個で置換されている炭素数が1～6の直鎖又は分岐鎖のアルキル－O－基を示し、例えばクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ又は2, 2, 2－トリフルオロエトキシ等の基を挙げることができる。
- [0077] $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、ハロアルコキシ部分及びアルキル部分が前記の意味を有する、炭素数が1～6のハロアルコキシ基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばクロロメトキシメチル、ジフルオロメトキシメチル、クロロジフルオロメトキシメチル、トリフルオロメトキシメチル又は2, 2, 2－トリフルオロエトキシメチル等の基を挙げることができる。
- [0078] $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基とは、特に限定しない限り

、ハロアルコキシ部分及びアルコキシ部分が前記の意味を有する、炭素数が1～6のハロアルコキシ基により置換された炭素数が1～6のアルコキシ基を示し、例えばクロロメトキシメトキシ、ジフルオロメトキシメトキシ、クロロジフルオロメトキシメトキシ、トリフルオロメトキシメトキシ又は2, 2, 2-トリフルオロエトキシメトキシ等の基を挙げることができる。

[0079] $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキルチオ部分、アルコキシ部分及びアルキル部分が前記の意味を有する、炭素数が1～6のアルキルチオ基により置換された炭素数が1～6のアルコキシ基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えば2-メチルチオエトキシメチル、2-エチルチオエトキシメチル等の基を挙げることができる。

[0080] $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキルスルフィニル部分、アルコキシ部分及びアルキル部分が前記の意味を有する、炭素数が1～6のアルキルスルフィニル基により置換された炭素数が1～6のアルコキシ基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えば2-メチルスルフィニルエトキシメチル、2-エチルスルフィニルエトキシメチル等の基を挙げることができる。

[0081] $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキルスルホニル部分、アルコキシ部分及びアルキル部分が前記の意味を有する、炭素数が1～6のアルキルスルホニル基により置換された炭素数が1～6のアルコキシ基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えば2-メチルスルホニルエトキシメチル、2-エチルスルホニルエトキシメチル等の基を挙げることができる。

[0082] シアノ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルコキシ部分及びアルキル部分が前記の意味を有する、シアノ基により置換された炭素数が1～6のアルコキシ基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えば2-シアノエトキシメチル、3-シアノプロポ

キシメチル等の基を挙げることができる。

- [0083] シアノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が前記の意味を有する、シアノ基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばシアノメチル、2-シアノエチル等の基を挙げることができる。
- [0084] $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が前記の意味を有する炭素数が1～6の（アルキル）-C(=O)-O-基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばアセトキシメチル、プロピオニルオキシメチル、イソプロピオニルオキシメチル、ピバロイルオキシメチル等の基を挙げることができる。
- [0085] $C_1 \sim C_6$ アシル $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アシル部分及びアルキル部分が前記の意味を有する炭素数が1～6のアシル基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えば2-オキソプロピル、3-オキソプロピル、2-オキソブチル等の基を挙げることができる。
- [0086] ジ ($C_1 \sim C_6$ アルコキシ) $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルコキシ部分及びアルキル部分が前記の意味を有する炭素数が1～6のアルコキシ基でジ置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えば（2, 2-ジメトキシ）エチル、（3, 3-ジメトキシ）プロピル、（2, 2-ジエトキシ）エチル、（3, 3-ジエトキシ）プロピル等の基を挙げることができる。
- [0087] $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルコキシ部分及びアルキル部分が前記の意味を有する炭素数が1～6のアルコキシカルボニル基で置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えば2-メトキシ-2-オキソエチル、2-エトキシ-2-オキソエチル、2-tert-ブトキシ-2-オキソエチル等の基を挙げることができる。
- [0088] $C_1 \sim C_6$ アルコキシイミノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルコキシ部分及びアルキル部分が上記の意味である炭素数が1～6の（

アルコキシ) -N=により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えば2-メトキシイミノエチル、3-メトキシイミノプロピル等の基を挙げることができる。

[0089] $C_6 \sim C_{10}$ アリール基とは、フェニル又はナフチル等の基を挙げることができる。

[0090] $C_6 \sim C_{10}$ アリール $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アリール部分及びアルキル部分が上記の意味である炭素数が6～10のアリール基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばベンジル、フェネチル、3-フェニルプロピル、ナフタレン-1-イルメチル、ナフタレン-2-イルメチル等の基を挙げることができる。

[0091] $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル基とは、特に限定しない限り、シクロアルキル部分及びハロゲン原子が上記の意味であるハロゲン原子1～5個、好ましくは1～3により置換された炭素数が3～8のシクロアルキル基を示し、2, 2-ジフルオロシクロプロピル、2, 2-ジクロロシクロプロピル等の基を挙げることができる。

[0092] ニトロ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が上記の意味であるニトロ基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、ニトロメチル、2-ニトロエチル等の基を挙げることができる。

[0093] ヒドロキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が上記の意味であるヒドロキシ基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、2-ヒドロキシエチル、3-ヒドロキシプロピル等の基を挙げることができる。

[0094] $C_1 \sim C_6$ アシルアミノ基とは、特に限定しない限り、アシル部分が上記の意味である炭素数が1～6のアシル基により置換されたアミノ基を示し、ホルムアミド、アセトアミド、プロピオンアミド等の基を挙げることができる。

[0095] $(R^6 R^7 N - C = O) C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が上記の意味である、 $(R^6 R^7 N - C = O)$ により置換された炭

素数が1～6のアルキル基を示し、 R^6 及び R^7 は前記した基を示す。例えば、N、N-ジメチルアミノカルボニルメチル、N、N-ジメチルアミノカルボニルエチル、N-メチル-N-エチルアミノカルボニルメチル等の基を挙げることができる。

[0096] $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖とは、特に限定しない限り、炭素数が2～5の直鎖又は分岐鎖状のアルキル基において、2個の異なる炭素原子から原子価が出ている2価のアルキル基を示し、例えば、エチレン、トリメチレン、プロピレン、テトラメチレン、ペンタメチレン等の基を挙げることができる。

[0097] 酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環オキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環部分及びアルキル部分が上記の意味である、(複素環)-O-基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えば2-(2-ピリジルオキシ)エチル、2-(2-ピラジニルオキシ)エチル、2-(2-チアゾリル)エチル等の基を挙げることができる。

[0098] $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分、アルコキシ部分及びシクロアルキル部分が上記の意味である、炭素数が3～8のシクロアルキル基により置換された炭素数が1～6のアルコキシ基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばシクロプロピルメチルオキシメチル、シクロブチルメチルオキシメチル、シクロペンチルメチルオキシメチル又はシクロヘキシルメチルオキシメチル等の基を挙げることができる。

[0099] フェニルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が上記の意味である、(フェニル)-S-O-基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばフェニルスルフィニルメチル、2-フェニルスルフィニルエチル、3-フェニルスルフィニルプロピル等の基を挙げることができる。

[0100] フェニルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキル部分が上記の意味である、(フェニル) $-SO_2-$ 基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えば2-フェニルスルホニルエチル、3-フェニルスルホニルプロピル、4-フェニルスルホニルブチル等の基を挙げることができる。

[0101] $C_1 \sim C_6$ アルキリデン基とは、特に限定しない限り、炭素数が1～6の直鎖又は分岐鎖状のアルキル基において、同じ炭素原子から2個の原子価が出ている2価のアルキル基を示し、例えばメチレン、エチリデン、プロピリデン、イソプロピリデン等の基を挙げることができる。

[0102] $C_1 \sim C_6$ アルキリデンアミノオキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、アルキリデン部分及びアルキル部分が上記の意味である炭素数が1～6の(アルキリデン) $=N-O-$ により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、例えばメチレンアミノオキシメチル、2-(エチリデンアミノオキシ)エチル、2-(イソプロピリデンアミノオキシ)エチル等の基を挙げることができる。

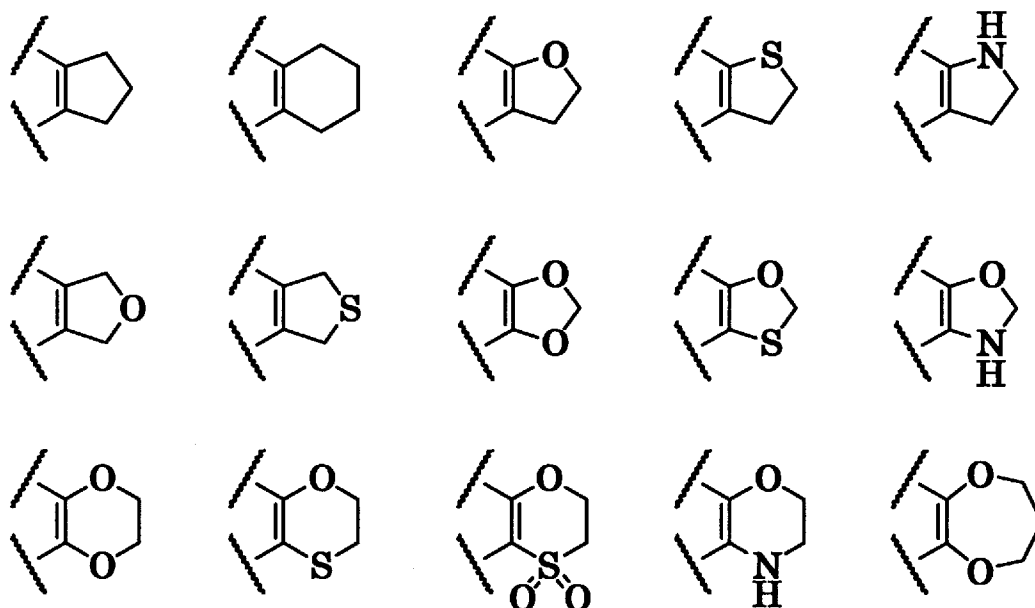
[0103] $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルキル基とは、特に限定しない限り、シクロアルキル部分、アルキル部分及びハロゲン原子が上記の意味であるハロゲン原子1～5個、好ましくは1～3により置換された炭素数が3～8のシクロアルキル基により置換された炭素数が1～6のアルキル基を示し、2, 2-ジフルオロシクロプロピルメチル、2, 2-ジクロロシクロプロピルメチル等の基を挙げることができる。

アルカリ金属としては、ナトリウム、カリウム等が好ましい。

[0104] 「隣接した2個の R^2 が一緒になって、これらが直接結合している炭素原子と共に、炭素環又は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～4個のヘテロ原子を有する複素環である4～8員環を形成してもよい」、「隣接した2個の R^2 が一緒になって、これらが直接結合している炭素原子と共に、炭素環又は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～4個のヘテロ原子を有する複素環である4～8員環を形成してもよい」、「隣接した

2個の R^4 が一緒になって、これらが直接結合している炭素原子と共に、炭素環又は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～4個のヘテロ原子を有する複素環である4～8員環を形成してもよい」、及び「隣接した2個の R^5 が一緒になって、それぞれの R^5 が直接結合している炭素原子と共に、炭素環又は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～4個のヘテロ原子を有する複素環である4～8員環を形成してもよい」とは、特に限定しない限り、下記のものなどを挙げることができる。

[0105] [化2]



[0106] このときに形成された環はハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基、又はオキソ基で置換されてもよい。

[0107] 本発明の一般式 [I] における X^1 としては、酸素原子又は硫黄原子が挙げられる。好ましい X^1 としては、酸素原子が挙げられる。一般式 [I] においては、 X^1 は(チオ)カルボニル基の形式で記載しているが、隣接する窒素原子の置換基 R^1 が水素原子のような場合には、カルボニル型でなく、その互変異性体であるエノール型として存在していてもよい。

[0108] 本発明の一般式 [I] における X^2 、 X^3 、及び X^4 は、それぞれ独立して $=CH-$ 又は $=N(O)_m-$ を表す(但し、 m は、0又は1の整数を表す。)。

好ましい X^2 、 X^3 、及び X^4 の組み合わせとしては、例えば、次のものが挙げられる。 X^2 、 X^3 、及び X^4 の全てが $=CH-$ の場合には、 X^2 を含む6員環はピリジン環に縮合するベンゼン環となり、キノリン環を形成することになる。 X^2 が $=N(O)m-$ を表し、 X^3 及び X^4 が $=CH-$ の場合には、 X^2 を含む6員環はピリジン環に縮合するピリジン環となり、1, 8-ナフチリジン環を形成することになる。 X^2 及び X^3 が $=N(O)m-$ を表し、 X^4 が $=CH-$ の場合には、 X^2 を含む6員環はピリジン環に縮合するピリミジン環となり、ピリドピリミジン環を形成することになる。 X^2 及び X^3 が $=CH-$ を表し、 X^4 が $=N(O)m-$ の場合には、 X^2 を含む6員環はピリジン環に縮合するピリジン環となり、1, 5-ナフチリジン環を形成することになる。このようにして形成された X^2 を含む6員環の炭素原子は、置換基 R^2 により置換されていてもよい。本明細書においては、このことを「当該炭素原子は R^2 により置換されていてもよい。」と表現している。また、 X^2 、 X^3 、又は X^4 が、 $=N(O)m-$ を表す場合で、 m が1の場合には、 X^2 を含む6員環の窒素原子はN-オキサイドとなり、N-オキサイド環を形成することになる。本発明の一般式 [I] における好ましい X^2 、 X^3 、及び X^4 としては、 $=CH-$ 、 $=C(R^2)-$ 、又は $=N-$ が挙げられる。

[0109] 本発明の一般式 [I] において好ましい R^1 としては、水素原子； $C_1 \sim C_1$ ₂アルキル基； $C_2 \sim C_6$ アルケニル基； $C_2 \sim C_6$ アルキニル基； $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基； $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基；フェニルオキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基；テトラヒドロフラニル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基；シアノ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基；シアノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アシル $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アル

コキシカルボニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $(R^6 R^7 N - C = O) C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_6 \sim C_{10}$ アリール $C_1 \sim C_6$ アルキル基（該基のアリールは、1又は2個以上の同一又は異なる R^4 により置換されてもよい。）；複素環 $C_1 \sim C_6$ アルキル基（該基は、1又は2個以上の同一又は異なる R^5 により置換されてもよい。）； $NR^8 R^9$ 基； $C_6 \sim C_{10}$ アリール基（該基は、1又は2個以上の同一又は異なる R^4 により置換されてもよい。）；又は複素環基（該基は、1又は2個以上の同一又は異なる R^5 により置換されてもよい。）等があげられる。

さらに、好ましい R^1 としては、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、テトラヒドロフラニル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、シアノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール $C_1 \sim C_6$ アルキル基（該基のアリールは、1又は2個以上の同一又は異なる R^4 により置換されてもよい。）、複素環 $C_1 \sim C_6$ アルキル基（該基は、1又は2個以上の同一又は異なる R^5 により置換されてもよい。）、 $C_6 \sim C_{10}$ アリール基（該基は、1又は2個以上の同一又は異なる R^4 により置換されてもよい。）、又は複素環基（該基は、1又は2個以上の同一又は異なる R^5 により置換されてもよい）などが挙げられる。

[0110] 本発明の一般式 [I] において好ましい R^2 としては、ハロゲン原子；ニトロ基； $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基；又は $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基などが挙げられる。

[0111] より好ましい R^2 としては、ハロゲン原子； $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基；又は C_1

～C₆アルキルスルホニル基などが挙げられ、さらに好ましくは、ハロゲン原子；C₁～C₆アルキル基；C₁～C₆ハロアルキル基；C₁～C₆アルコキシ基が挙げられる。

[0112] 本発明の一般式 [I] においては好ましいnとしては0～2、より好ましくは0～1である。

[0113] 本発明の一般式 [I] において好ましいR³としては、ヒドロキシル基、O⁻M⁺（M⁺はアルカリ金属カチオン又はアンモニウムカチオンを示す。）、アミノ基、ハロゲン原子、C₁～C₆アルキルスルホニルオキシ基、C₁～C₆アルキルチオ基、C₁～C₆アルキルスルフィニル基、C₁～C₆アルキルスルホニル基、C₁～C₆ハロアルキルチオ基、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル基、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル基、C₂～C₆アルケニルチオ基、C₂～C₆アルケニルスルフィニル基、C₂～C₆アルケニルスルホニル基、C₂～C₆アルキニルチオ基、C₂～C₆アルキニルスルフィニル基、C₂～C₆アルキニルスルホニル基、C₂～C₆アルケニルカルボニルオキシ基、C₂～C₆アルキニルカルボニルオキシ基、フェノキシ基（該基は、1又は2～5個の同一もしくは異なるR¹⁰により置換されてもよい。）、フェニルチオ基（該基は、1又は2～5個の同一もしくは異なるR¹⁰により置換されてもよい。）、フェニルスルフィニル基（該基は、1又は2～5個の同一もしくは異なるR¹⁰により置換されてもよい。）、フェニルスルホニル基（該基は、1又は2～5個の同一もしくは異なるR¹⁰により置換されてもよい。）、フェニルスルホニルオキシ基（該基は、1又は2～5個の同一もしくは異なるR¹⁰により置換されてもよい。）、フェニルカルボニルオキシ基（該基は、1又は2～5個の同一もしくは異なるR¹⁰により置換されてもよい。）、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基、イミダゾール-1-イル基、ピラゾール-1-イル基、又はテトラゾール-1-イル基などが挙げられる。

[0114] さらに好ましいR³としては、ヒドロキシル基が挙げられる。当該ヒドロキシル基は、これら塩、エーテル、エステルなどの誘導体であってもよい。また、遊離のヒドロキシ基は隣接する二重結合により、その互変異性体である

ケト型として存在していてもよい。

[0115] 本発明の一般式 [I] において好ましい R^4 としては、ハロゲン原子；ヒドロキシル基；ニトロ基；シアノ基； $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ基； $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基； $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルキルオキシ基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基；シアノ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_1 \sim C_6$ アシル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル基；ジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノ基；又は複素環 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基（該基の酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環は、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。）などが挙げられる。

より好ましい R^4 としては、ハロゲン原子； $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ基； $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基；又は $C_1 \sim C_6$ アシル基などが挙げられる。

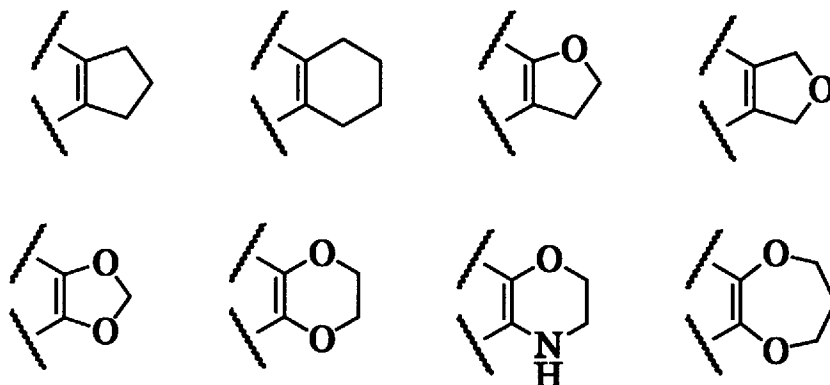
さらに好ましい R^4 としては、ハロゲン原子； $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基；又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基などが挙げられる。

また、 R^4 は、隣接した2個の R^4 が一緒になって、それぞれの R^4 が直接結合している炭素原子と共に、炭素環、又は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～4個のヘテロ原子を有する複素環である4～8員環を形成することも好ましい。

このような炭素環又は複素環の好ましい例としては次の構造式で示されるものが挙げられる。

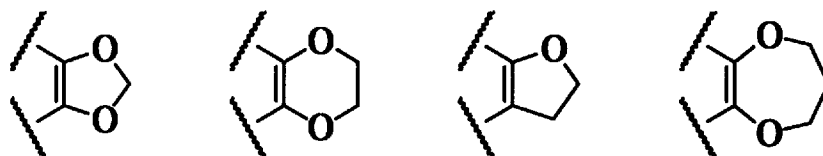
[0116]

[化3]



[0117] また、より好ましい複素環としては、次の構造式で示されるものが挙げられる。

[0118] [化4]



[0119] さらに好ましい複素環としては、次の構造式で示されるものが挙げられる。

[0120] [化5]



[0121] 本発明の一般式 [I] において好ましい R^5 としては、ハロゲン原子；シアノ基；ニトロ基； $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基； $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基；又はオキソ基などがあげられる。

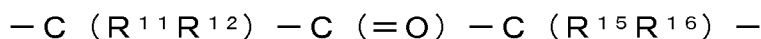
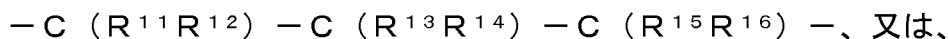
より好ましい R^5 としては、ハロゲン原子； $C_1 \sim C_6$ アルキル基；又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基などがあげられる。

[0122] 本発明の一般式 [I] における A^1 は、 $-C(R^{11}R^{12})-$ を表す。

[0123] 本発明の一般式 [I] における A^2 は、 $-C(R^{13}R^{14})-$ 、又は $C=O$ を表す。

[0124] 本発明の一般式 [I] における A^3 は、 $-C(R^{15}R^{16})-$ を表す。

[0125] 即ち、本発明の一般式 [I] における $-A^1-A^2-A^3-$ は、



を表し、これらが隣接する炭素原子と共に 6 員の炭素環を形成する。

[0126] ここにおける R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 及び R^{16} としては、それぞれ互いに独立して、水素原子；又は $C_1 \sim C_6$ アルキル基があげられる。また、 R^{11} と R^{16} とが一緒になって、隣接する炭素原子と共に 5 ～ 10 員、好ましくは 5 ～ 8 員の炭素環を形成してもよい。即ち、 R^{11} と R^{16} とが一緒になって 2 価の直鎖状又は分岐状の $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖となることもできる。好ましいアルキレン基としては、エチレン基が挙げられる。

[0127] 「酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より任意に選択される 1 ～ 5 個のヘテロ原子を有する炭素数 2 ～ 10 の複素環基」、「酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される 1 ～ 5 個のヘテロ原子を有する炭素数 2 ～ 10 の複素環 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基」、「酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される 1 ～ 5 個のヘテロ原子を有する炭素数 2 ～ 10 の複素環 $C_1 \sim C_6$ アルキル基」、又は「酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から任意に選択される 1 ～ 5 個のヘテロ原子を有する炭素数 2 ～ 10 の複素環 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基」で示される当該複素環基とは具体的には、例えば、テトラヒドロフラン、テトラヒドロチオフェン、テトラヒドロチオフェンジオキサイド、テトラヒドロチオピラン、テトラヒドロチオピランジオキサイド、4, 5-ジヒドロイソキサゾール、チオフェン、ピラゾール、オキサゾール、イソキサゾール、チアゾール、イソチアゾール、1, 2, 4-トリアゾール、1, 2, 4-オキサジアゾール、1, 3, 4-チアジアゾール、ピリジン、ピリダジン、ピリミジン、ピラジン、2, 3-ジヒドロベンゾフラン、1, 3-ベンゾジオキサール、ベンゾ-1, 4-ジオキサン、ベンゾフラン、イ

ンドールなどが挙げられる。

[0128] 好ましい複素環群としては、4, 5-ジヒドロイソキサゾール、チオフェン、ピラゾール、オキサゾール、イソキサゾール、チアゾール、イソチアゾール、ピリジン、ピラジン、1, 3-ベンゾジオキサソール、及びベンゾ-1, 4-ジオキサンなどがあげられる。さらに好ましい複素環としては、チオフェン、イソキサゾール、ピリジン、1, 3-ベンゾジオキサソール、及びベンゾ-1, 4-ジオキサンなどが挙げられる。

[0129] 本発明の一般式 [I] において示される複素環から形成される複素環基としては、選択された複素環の任意の位置における基とすることができる。選択された複素環がベンゼン環との縮合環である場合にも、基となる位置は、複素環部分に限定されるものではなく、ベンゼン環の部分を基とすることもできる。

[0130] 次に、本発明の式 [I] で示される化合物の好ましい具体例を次の表 1 ～ 表 6 6 に例示する。しかしながら、本発明化合物はこれらの化合物に限定されるものではない。なお、化合物番号は以後の記載において参照される。

[0131] 本明細書における表中の次の表記は下記の通りそれぞれ該当する基を表す。

例えば、

M e とはメチル基を示し、

E t とはエチル基を示し、

n - P r とは n - プロピル基を示し、

i - P r とはイソプロピル基を示し、

c - P r とはシクロプロピル基を示し、

n - B u とは n - ブチル基を示し、

s - B u とは s e c - ブチル基を示し、

i - B u とはイソブチル基を示し、

t - B u とは t e r t - ブチル基を示し、

c - B u とはシクロブチル基を示し、

n -P e n とは n -ペンチル基を示し、

c-P e n とはシクロペンチル基を示し、

n -H e x とは n -ヘキシル基を示し、

P h とはフェニル基を示し、

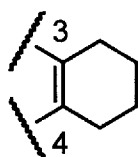
B n とはベンジル基を示し、

R^2 及び R^{12} において「-」とはそれらが無置換であることを示し、

(4-C l) B n とは 4-クロロベンジル基を示し、

3, 4-(C H₂ C H₂ C H₂ C H₂)- とは、3 位と 4 位が当該ブチレン基で結合されて環を形成した次の化学構造、

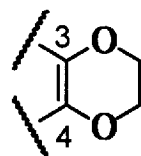
[0132] [化6]



[0133] を示し、

3, 4-(O C H₂ C H₂ O)- とは、同様に 3 位と 4 位が当該エチレンジオキシ基で結合されて環を形成した次の化学構造、

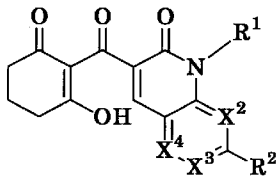
[0134] [化7]



[0135] を示す。

[0136]

[表1]

					
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
I-1	H	H	CH	CH	CH
I-2	Me	H	CH	CH	CH
I-3	Et	H	CH	CH	CH
I-4	n-Pr	H	CH	CH	CH
I-5	i-Pr	H	CH	CH	CH
I-6	c-Pr	H	CH	CH	CH
I-7	n-Bu	H	CH	CH	CH
I-8	i-Bu	H	CH	CH	CH
I-9	t-Bu	H	CH	CH	CH
I-10	c-Pen	H	CH	CH	CH
I-11	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH	CH	CH
I-12	CH ₂ C≡CH	H	CH	CH	CH
I-13	CH ₂ CF ₃	H	CH	CH	CH
I-14	C ₂ H ₄ OCH ₃	H	CH	CH	CH
I-15	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	H	CH	CH	CH
I-16	CH(Me)OEt	H	CH	CH	CH
I-17	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CH	CH	CH
I-18	CH ₂ SMe	H	CH	CH	CH
I-19	CH ₂ SEt	H	CH	CH	CH
I-20	CH ₂ SOMe	H	CH	CH	CH
I-21	CH ₂ SOEt	H	CH	CH	CH
I-22	CH ₂ SO ₂ Me	H	CH	CH	CH
I-23	CH ₂ SO ₂ Et	H	CH	CH	CH
I-24	Bn	H	CH	CH	CH
I-25	(2-F)Bn	H	CH	CH	CH
I-26	(3-F)Bn	H	CH	CH	CH
I-27	(4-F)Bn	H	CH	CH	CH
I-28	(2-Cl)Bn	H	CH	CH	CH
I-29	(3-Cl)Bn	H	CH	CH	CH
I-30	(4-Cl)Bn	H	CH	CH	CH

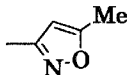
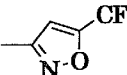
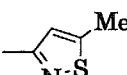
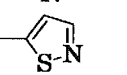
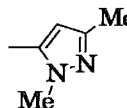
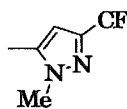
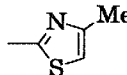
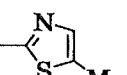
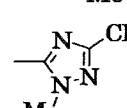
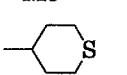
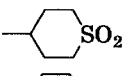
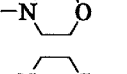
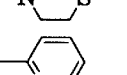
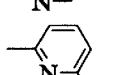
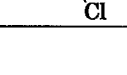
[0137]

[表2]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
I-31	(2-Me)Bn	H	CH	CH	CH
I-32	(3-Me)Bn	H	CH	CH	CH
I-33	(4-Me)Bn	H	CH	CH	CH
I-34	(2-CF ₃)Bn	H	CH	CH	CH
I-35	(3-CF ₃)Bn	H	CH	CH	CH
I-36	(4-CF ₃)Bn	H	CH	CH	CH
I-37	(2-OMe)Bn	H	CH	CH	CH
I-38	(3-OMe)Bn	H	CH	CH	CH
I-39	(4-OMe)Bn	H	CH	CH	CH
I-40	CH(Me)Ph	H	CH	CH	CH
I-41	Ph	H	CH	CH	CH
I-42	(2-F)Ph	H	CH	CH	CH
I-43	(3-F)Ph	H	CH	CH	CH
I-44	(4-F)Ph	H	CH	CH	CH
I-45	(2-Cl)Ph	H	CH	CH	CH
I-46	(3-Cl)Ph	H	CH	CH	CH
I-47	(4-Cl)Ph	H	CH	CH	CH
I-48	(2-Me)Ph	H	CH	CH	CH
I-49	(3-Me)Ph	H	CH	CH	CH
I-50	(4-Me)Ph	H	CH	CH	CH
I-51	(2-CF ₃)Ph	H	CH	CH	CH
I-52	(3-CF ₃)Ph	H	CH	CH	CH
I-53	(4-CF ₃)Ph	H	CH	CH	CH
I-54	(2-OMe)Ph	H	CH	CH	CH
I-55	(3-OMe)Ph	H	CH	CH	CH
I-56	(4-OMe)Ph	H	CH	CH	CH
I-57	(3-F-4-OMe)Ph	H	CH	CH	CH
I-58	(3-F-4-Me)Ph	H	CH	CH	CH
I-59	(4-F-3-Me)Ph	H	CH	CH	CH
I-60		H	CH	CH	CH
I-61		H	CH	CH	CH
I-62		H	CH	CH	CH

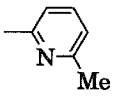
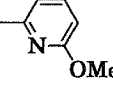
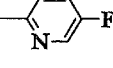
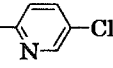
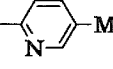
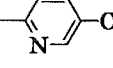
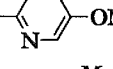
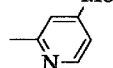
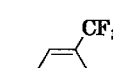
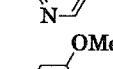
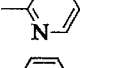
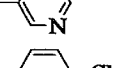
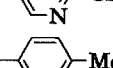
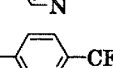
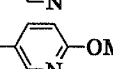
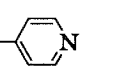
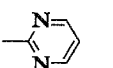
[0138]

[表3]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
I-63		H	CH	CH	CH
I-64		H	CH	CH	CH
I-65		H	CH	CH	CH
I-66		H	CH	CH	CH
I-67		H	CH	CH	CH
I-68		H	CH	CH	CH
I-69		H	CH	CH	CH
I-70		H	CH	CH	CH
I-71		H	CH	CH	CH
I-72		H	CH	CH	CH
I-73		H	CH	CH	CH
I-74		H	CH	CH	CH
I-75		H	CH	CH	CH
I-76		H	CH	CH	CH
I-77		H	CH	CH	CH

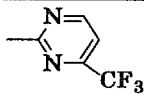
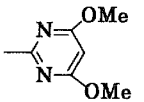
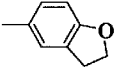
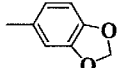
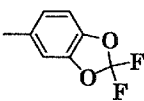
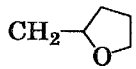
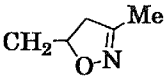
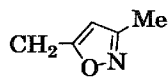
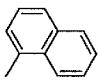
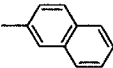
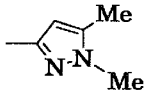
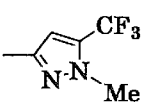
[0139]

[表4]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
I-78		H	CH	CH	CH
I-79		H	CH	CH	CH
I-80		H	CH	CH	CH
I-81		H	CH	CH	CH
I-82		H	CH	CH	CH
I-83		H	CH	CH	CH
I-84		H	CH	CH	CH
I-85		H	CH	CH	CH
I-86		H	CH	CH	CH
I-87		H	CH	CH	CH
I-88		H	CH	CH	CH
I-89		H	CH	CH	CH
I-90		H	CH	CH	CH
I-91		H	CH	CH	CH
I-92		H	CH	CH	CH
I-93		H	CH	CH	CH
I-94		H	CH	CH	CH

[0140]

[表5]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
I-95		H	CH	CH	CH
I-96		H	CH	CH	CH
I-97		H	CH	CH	CH
I-98		H	CH	CH	CH
I-99		H	CH	CH	CH
I-100		H	CH	CH	CH
I-101		H	CH	CH	CH
I-102		H	CH	CH	CH
I-103	NH ₂	H	CH	CH	CH
I-104	NHMe	H	CH	CH	CH
I-105	OMe	H	CH	CH	CH
I-106	OEt	H	CH	CH	CH
I-107	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CH	CH	CH
I-108		H	CH	CH	CH
I-109		H	CH	CH	CH
I-110		H	CH	CH	CH
I-111		H	CH	CH	CH

[0141]

[表6]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
I-112		H	CH	CH	CH
I-113		H	CH	CH	CH
I-114		H	CH	CH	CH
I-115		H	CH	CH	CH
I-116		H	CH	CH	CH
I-118		H	CH	CH	CH
I-117		H	CH	CH	CH
I-119		H	CH	CH	CH
I-120	CH ₂ CN	H	CH	CH	CH
I-121	Me	Me	CH	CH	CH
I-122	Et	Me	CH	CH	CH
I-123	Ph	Me	CH	CH	CH
I-124	Bn	Me	CH	CH	CH
I-125	(4-OMe)Ph	Me	CH	CH	CH
I-126	Me	Et	CH	CH	CH
I-127	Et	Et	CH	CH	CH
I-128	Ph	Et	CH	CH	CH
I-129	Bn	Et	CH	CH	CH
I-130	(4-OMe)Ph	Et	CH	CH	CH
I-131	Me	i-Pr	CH	CH	CH
I-132	Et	i-Pr	CH	CH	CH
I-133	Ph	i-Pr	CH	CH	CH
I-134	Bn	i-Pr	CH	CH	CH
I-135	(4-OMe)Ph	i-Pr	CH	CH	CH
I-136	Me	CF ₃	CH	CH	CH

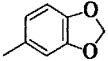
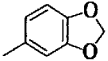
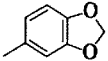
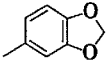
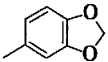
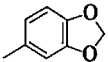
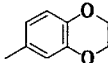
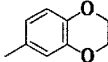
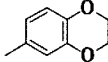
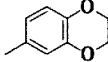
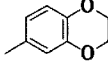
[0142]

[表7]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
I-137	Et	CF ₃	CH	CH	CH
I-138	Ph	CF ₃	CH	CH	CH
I-139	Bn	CF ₃	CH	CH	CH
I-140	(4-OMe)Ph	CF ₃	CH	CH	CH
I-141	Me	CF ₂ Cl	CH	CH	CH
I-142	Et	CF ₂ Cl	CH	CH	CH
I-143	Ph	CF ₂ Cl	CH	CH	CH
I-144	Bn	CF ₂ Cl	CH	CH	CH
I-145	(4-OMe)Ph	CF ₂ Cl	CH	CH	CH
I-146	Me	OCH ₃	CH	CH	CH
I-147	Et	OCH ₃	CH	CH	CH
I-148	Ph	OCH ₃	CH	CH	CH
I-149	Bn	OCH ₃	CH	CH	CH
I-150	(4-OMe)Ph	OCH ₃	CH	CH	CH
I-151	Me	H	CH	CH	CCH ₃
I-152	Et	H	CH	CH	CCH ₃
I-153	Ph	H	CH	CH	CCH ₃
I-154	Bn	H	CH	CH	CCH ₃
I-155	(4-OMe)Ph	H	CH	CH	CCH ₃
I-156	Me	H	CH	CH	CCl
I-157	Et	H	CH	CH	CCl
I-158	Ph	H	CH	CH	CCl
I-159	Bn	H	CH	CH	CCl
I-160	(4-OMe)Ph	H	CH	CH	CCl
I-161	Me	H	CH	CH	CF
I-162	Et	H	CH	CH	CF
I-163	Ph	H	CH	CH	CF
I-164	Bn	H	CH	CH	CF
I-165	(4-OMe)Ph	H	CH	CH	CF
I-166	Me	H	CH	CH	CBr
I-167	Et	H	CH	CH	CBr
I-168	Ph	H	CH	CH	CBr
I-169	Bn	H	CH	CH	CBr
I-170	(4-OMe)Ph	H	CH	CH	CBr
I-171	Me	Cl	CH	CH	CCl

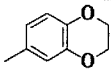
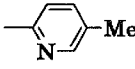
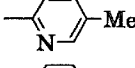
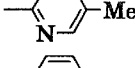
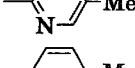
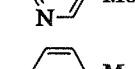
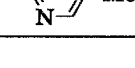
[0143]

[表8]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
I-172	Et	Cl	CH	CH	CCl
I-173	Ph	Cl	CH	CH	CCl
I-174	Bn	Cl	CH	CH	CCl
I-175	(4-OMe)Ph	Cl	CH	CH	CCl
I-176	Me	F	CH	CH	CF
I-177	Et	F	CH	CH	CF
I-178	Ph	F	CH	CH	CF
I-179	Bn	F	CH	CH	CF
I-180	(4-OMe)Ph	F	CH	CH	CF
I-181	Me	F	CF	CF	CF
I-182	Et	F	CF	CF	CF
I-183	Ph	F	CF	CF	CF
I-184	Bn	F	CF	CF	CF
I-185	(4-OMe)Ph	F	CF	CF	CF
I-186		Me	CH	CH	CH
I-187		OCH ₃	CH	CH	CH
I-188		H	CH	CH	CCH ₃
I-189		H	CH	CH	CCl
I-190		H	CH	CH	CF
I-191		H	CH	CH	CBr
I-192		Me	CH	CH	CH
I-193		OCH ₃	CH	CH	CH
I-194		H	CH	CH	CCH ₃
I-195		H	CH	CH	CCl
I-196		H	CH	CH	CF

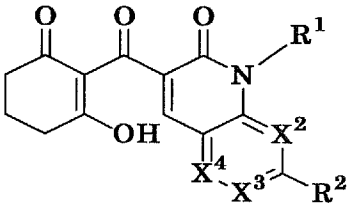
[0144]

[表9]

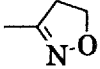
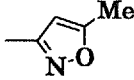
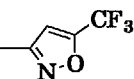
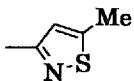
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
I-197		H	CH	CH	CBr
I-198		Me	CH	CH	CH
I-199		OCH ₃	CH	CH	CH
I-200		H	CH	CH	CCH ₃
I-201		H	CH	CH	CCl
I-202		H	CH	CH	CF
I-203		H	CH	CH	CBr

[0145]

[表10]

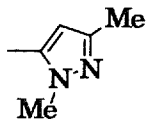
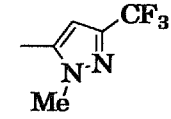
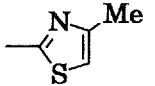
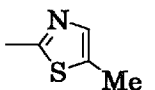
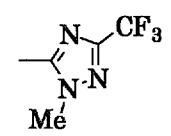
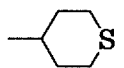
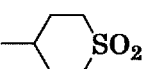
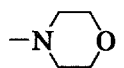
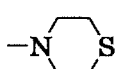
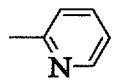
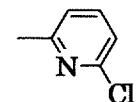
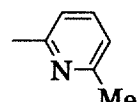
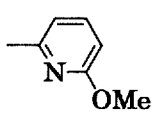
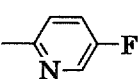
					
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-1	H	H	N	CH	CH
II-2	Me	H	N	CH	CH
II-3	Et	H	N	CH	CH
II-4	n-Pr	H	N	CH	CH
II-5	i-Pr	H	N	CH	CH
II-6	c-Pr	H	N	CH	CH
II-7	n-Bu	H	N	CH	CH
II-8	i-Bu	H	N	CH	CH
II-9	t-Bu	H	N	CH	CH
II-10	c-Pen	H	N	CH	CH
II-11	CH ₂ CH=CH ₂	H	N	CH	CH
II-12	CH ₂ C≡CH	H	N	CH	CH
II-13	CH ₂ CF ₃	H	N	CH	CH
II-14	C ₂ H ₄ OCH ₃	H	N	CH	CH
II-15	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	H	N	CH	CH
II-16	CH(Me)OEt	H	N	CH	CH
II-17	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	N	CH	CH
II-18	CH ₂ SMe	H	N	CH	CH
II-19	CH ₂ SEt	H	N	CH	CH
II-20	CH ₂ SOMe	H	N	CH	CH
II-21	CH ₂ SOEt	H	N	CH	CH
II-22	CH ₂ SO ₂ Me	H	N	CH	CH
II-23	CH ₂ SO ₂ Et	H	N	CH	CH
II-24	Bn	H	N	CH	CH
II-25	(2-F)Bn	H	N	CH	CH
II-26	(3-F)Bn	H	N	CH	CH
II-27	(4-F)Bn	H	N	CH	CH
II-28	(2-Cl)Bn	H	N	CH	CH
II-29	(3-Cl)Bn	H	N	CH	CH
II-30	(4-Cl)Bn	H	N	CH	CH
II-31	(2-Me)Bn	H	N	CH	CH
II-32	(3-Me)Bn	H	N	CH	CH
II-33	(4-Me)Bn	H	N	CH	CH
II-34	(2-CF ₃)Bn	H	N	CH	CH
II-35	(3-CF ₃)Bn	H	N	CH	CH

[0146] [表11]

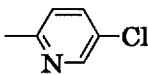
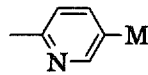
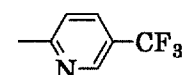
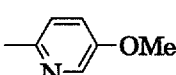
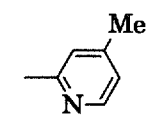
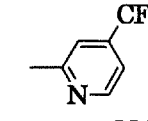
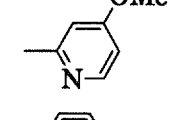
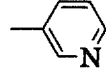
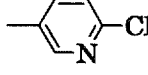
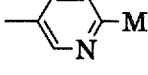
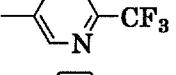
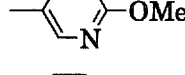
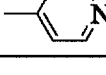
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-36	(4-CF ₃)Bn	H	N	CH	CH
II-37	(2-OMe)Bn	H	N	CH	CH
II-38	(3-OMe)Bn	H	N	CH	CH
II-39	(4-OMe)Bn	H	N	CH	CH
II-40	CH(Me)Ph	H	N	CH	CH
II-41	Ph	H	N	CH	CH
II-42	(2-F)Ph	H	N	CH	CH
II-43	(3-F)Ph	H	N	CH	CH
II-44	(4-F)Ph	H	N	CH	CH
II-45	(2-Cl)Ph	H	N	CH	CH
II-46	(3-Cl)Ph	H	N	CH	CH
II-47	(4-Cl)Ph	H	N	CH	CH
II-48	(2-Me)Ph	H	N	CH	CH
II-49	(3-Me)Ph	H	N	CH	CH
II-50	(4-Me)Ph	H	N	CH	CH
II-51	(2-CF ₃)Ph	H	N	CH	CH
II-52	(3-CF ₃)Ph	H	N	CH	CH
II-53	(4-CF ₃)Ph	H	N	CH	CH
II-54	(2-OMe)Ph	H	N	CH	CH
II-55	(3-OMe)Ph	H	N	CH	CH
II-56	(4-OMe)Ph	H	N	CH	CH
II-57	(3-F-4-OMe)Ph	H	N	CH	CH
II-58	(2,5-Me ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-59	(4-F-3-Me)Ph	H	N	CH	CH
II-60		H	N	CH	CH
II-61		H	N	CH	CH
II-62		H	N	CH	CH
II-63		H	N	CH	CH
II-64		H	N	CH	CH
II-65		H	N	CH	CH
II-66		H	N	CH	CH

[0147]

[表12]

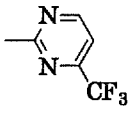
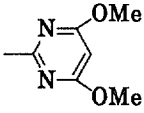
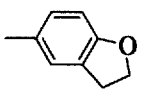
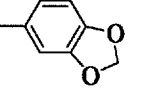
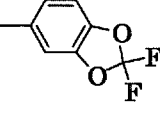
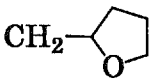
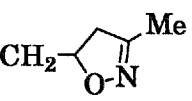
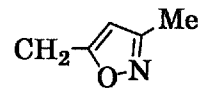
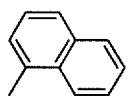
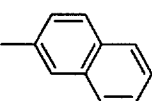
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-67		H	N	CH	CH
II-68		H	N	CH	CH
II-69		H	N	CH	CH
II-70		H	N	CH	CH
II-71		H	N	CH	CH
II-72		H	N	CH	CH
II-73		H	N	CH	CH
II-74		H	N	CH	CH
II-75		H	N	CH	CH
II-76		H	N	CH	CH
II-77		H	N	CH	CH
II-78		H	N	CH	CH
II-79		H	N	CH	CH
II-80		H	N	CH	CH

[表13]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-81		H	N	CH	CH
II-82		H	N	CH	CH
II-83		H	N	CH	CH
II-84		H	N	CH	CH
II-85		H	N	CH	CH
II-86		H	N	CH	CH
II-87		H	N	CH	CH
II-88		H	N	CH	CH
II-89		H	N	CH	CH
II-90		H	N	CH	CH
II-91		H	N	CH	CH
II-92		H	N	CH	CH
II-93		H	N	CH	CH

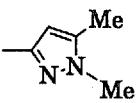
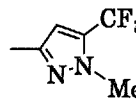
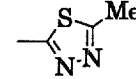
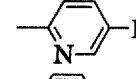
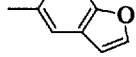
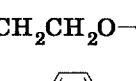
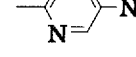
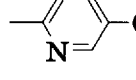
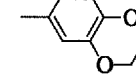
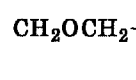
[0149]

[表14]

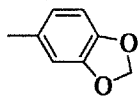
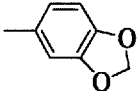
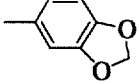
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-94		H	N	CH	CH
II-95		H	N	CH	CH
II-96		H	N	CH	CH
II-97		H	N	CH	CH
II-98		H	N	CH	CH
II-99		H	N	CH	CH
II-100		H	N	CH	CH
II-101		H	N	CH	CH
II-102		H	N	CH	CH
II-103	NH ₂	H	N	CH	CH
II-104	NHMe	H	N	CH	CH
II-105	OMe	H	N	CH	CH
II-106	OE _t	H	N	CH	CH
II-107	CH ₂ CH ₂ OMe	H	N	CH	CH
II-108		H	N	CH	CH
II-109		H	N	CH	CH

[0150]

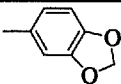
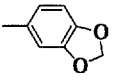
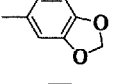
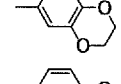
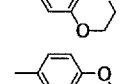
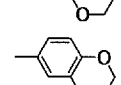
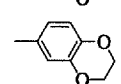
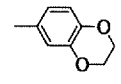
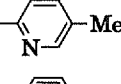
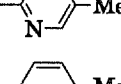
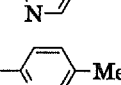
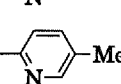
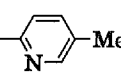
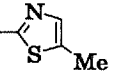
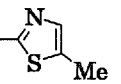
[表15]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-110		H	N	CH	CH
II-111		H	N	CH	CH
II-112		H	N	CH	CH
II-113		H	N	CH	CH
II-114		H	N	CH	CH
II-115		H	N	CH	CH
II-116		H	N	CH	CH
II-117		H	N	CH	CH
II-118		H	N	CH	CH
II-119		H	N	CH	CH
II-120	CH ₂ CN	H	N	CH	CH
II-121	Me	Me	N	CH	CH
II-122	Et	Me	N	CH	CH
II-123	Ph	Me	N	CH	CH
II-124	Bn	Me	N	CH	CH
II-125	(4-OMe)Ph	Me	N	CH	CH
II-126	Me	i-Pr	N	CH	CH
II-127	Et	i-Pr	N	CH	CH
II-128	Ph	i-Pr	N	CH	CH
II-129	Bn	i-Pr	N	CH	CH
II-130	(4-OMe)Ph	i-Pr	N	CH	CH
II-131	Me	CHF ₂	N	CH	CH
II-132	Et	CHF ₂	N	CH	CH
II-133	Ph	CHF ₂	N	CH	CH
II-134	Bn	CHF ₂	N	CH	CH
II-135	(4-OMe)Ph	CHF ₂	N	CH	CH
II-136	Me	CF ₃	N	CH	CH
II-137	Et	CF ₃	N	CH	CH

[0151] [表16]

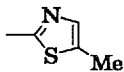
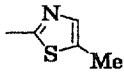
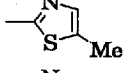
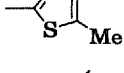
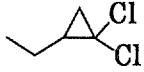
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-138	Ph	CF ₃	N	CH	CH
II-139	Bn	CF ₃	N	CH	CH
II-140	(4-OMe)Ph	CF ₃	N	CH	CH
II-141	Me	CF ₂ Cl	N	CH	CH
II-142	Et	CF ₂ Cl	N	CH	CH
II-143	Ph	CF ₂ Cl	N	CH	CH
II-144	Bn	CF ₂ Cl	N	CH	CH
II-145	(4-OMe)Ph	CF ₂ Cl	N	CH	CH
II-146	Me	OCH ₃	N	CH	CH
II-147	Et	OCH ₃	N	CH	CH
II-148	Ph	OCH ₃	N	CH	CH
II-149	Bn	OCH ₃	N	CH	CH
II-150	(4-OMe)Ph	OCH ₃	N	CH	CH
II-151	Me	H	N	CH	CCH ₃
II-152	Et	H	N	CH	CCH ₃
II-153	Ph	H	N	CH	CCH ₃
II-154	Bn	H	N	CH	CCH ₃
II-155	(4-OMe)Ph	H	N	CH	CCH ₃
II-156	Me	H	N	CH	CCl
II-157	Et	H	N	CH	CCl
II-158	Ph	H	N	CH	CCl
II-159	Bn	H	N	CH	CCl
II-160	(4-OMe)Ph	H	N	CH	CCl
II-161	Me	H	N	CH	CF
II-162	Et	H	N	CH	CF
II-163	Ph	H	N	CH	CF
II-164	Bn	H	N	CH	CF
II-165	(4-OMe)Ph	H	N	CH	CF
II-166	Me	H	N	CH	CBr
II-167	Et	H	N	CH	CBr
II-168	Ph	H	N	CH	CBr
II-169	Bn	H	N	CH	CBr
II-170	(4-OMe)Ph	H	N	CH	CBr
II-171		Me	N	CH	CH
II-172		OCH ₃	N	CH	CH
II-173		H	N	CH	CCH ₃

[0152] [表17]

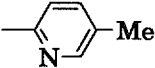
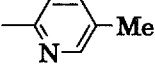
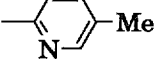
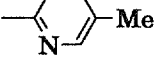
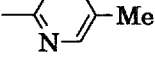
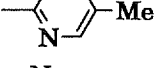
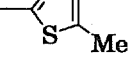
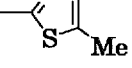
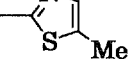
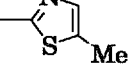
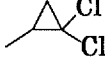
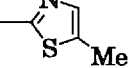
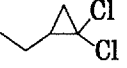
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-174		H	N	CH	CCl
II-175		H	N	CH	CF
II-176		H	N	CH	CBr
II-177		Me	N	CH	CH
II-178		OCH ₃	N	CH	CH
II-179		H	N	CH	CCH ₃
II-180		H	N	CH	CCl
II-181		H	N	CH	CF
II-182		H	N	CH	CBr
II-183		Me	N	CH	CH
II-184		OCH ₃	N	CH	CH
II-185		H	N	CH	CCH ₃
II-186		H	N	CH	CCl
II-187		H	CH	CH	CF
II-188		H	CH	CH	CBr
II-189		Me	N	CH	CH
II-190		OCH ₃	N	CH	CH

[0153]

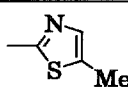
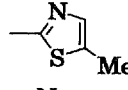
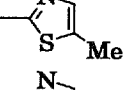
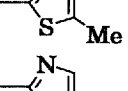
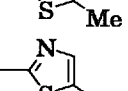
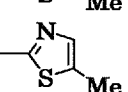
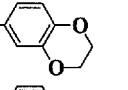
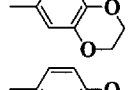
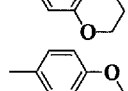
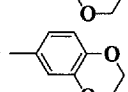
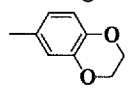
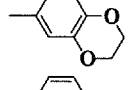
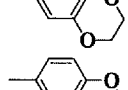
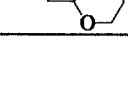
[表18]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-191		H	N	CH	CCH ₃
II-192		H	N	CH	CCl
II-193		H	CH	CH	CF
II-194		H	CH	CH	CBr
II-195	(4-Me)Ph	Me	N	CH	CH
II-196	(4-Me)Ph	OCH ₃	N	CH	CH
II-197	(4-Me)Ph	H	N	CH	CCH ₃
II-198	(4-Me)Ph	H	N	CH	CCl
II-199	(4-Me)Ph	H	CH	CH	CF
II-200	(4-Me)Ph	H	CH	CH	CBr
II-201	CH ₂ c-Pr	H	N	CH	CH
II-202	CH ₂ CH=CF ₂	H	N	CH	CH
II-203	CH ₂ C≡CF	H	N	CH	CH
II-204		H	N	CH	CH
II-205		H	N	CH	CH
II-206	CH ₂ NH ₂	H	N	CH	CH
II-207	CH ₂ NO ₂	H	N	CH	CH
II-208	CH ₂ NHCH ₃	H	N	CH	CH
II-209	CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	N	CH	CH
II-210	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	H	N	CH	CH
II-211	CH ₂ SOCH ₂ CF ₃	H	N	CH	CH
II-212	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	N	CH	CH
II-213	CH ₂ OH	H	N	CH	CH
II-214	CH ₂ OBn	H	N	CH	CH
II-215	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃	H	N	CH	CH
II-216	CH ₂ Oc-Pr	H	N	CH	CH
II-217	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	H	N	CH	CH
II-218	CH ₂ OPh	H	N	CH	CH
II-219	CH ₂ SPh	H	N	CH	CH
II-220	CH ₂ SOPh	H	N	CH	CH
II-221	CH ₂ SO ₂ Ph	H	N	CH	CH
II-222	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ SCH ₃	H	N	CH	CH

[表19]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-223	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ SOCH ₃	H	N	CH	CH
II-224	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ SO ₂ CH ₃	H	N	CH	CH
II-225	CH ₂ OCH ₂ CN	H	N	CH	CH
II-226	CH ₂ CN	H	N	CH	CH
II-227	CH ₂ OCOCH ₃	H	N	CH	CH
II-228	CH ₂ COCH ₃	H	N	CH	CH
II-229	CH(OCH ₃) ₂	H	N	CH	CH
II-230	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	N	CH	CH
II-231	CH ₂ CH=NOCH ₃	H	N	CH	CH
II-232	CH ₂ ON=CHCH ₃	H	N	CH	CH
II-233	CH ₂ CON(CH ₃) ₂	H	N	CH	CH
II-234	N(CH ₃) ₂	H	N	CH	CH
II-235	OCH ₃	H	N	CH	CH
II-236		OH	N	CH	CH
II-237		NO ₂	N	CH	CH
II-238		CN	N	CH	CH
II-239		c-Pr	N	CH	CH
II-240		CH ₂ c-Pr	N	CH	CH
II-241		CH ₂ CH=CH ₂	N	CH	CH
II-242		CH ₂ C≡CH	N	CH	CH
II-243		CH ₂ CH=CF ₂	N	CH	CH
II-244		CH ₂ C≡CF	N	CH	CH
II-245			N	CH	CH
II-246			N	CH	CH

[表20]

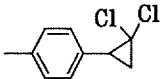
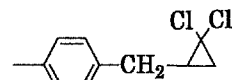
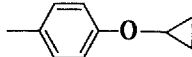
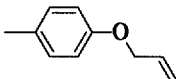
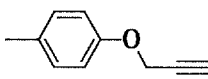
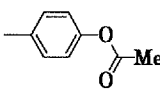
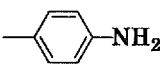
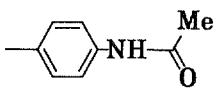
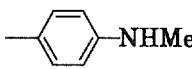
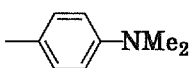
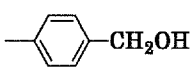
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-247		Oc-Pr	N	CH	CH
II-248		OCH ₂ c-Pr	N	CH	CH
II-249		OCH ₂ CH=CH ₂	N	CH	CH
II-250		OCH ₂ C≡CH	N	CH	CH
II-251		OCHF ₂	N	CH	CH
II-252		OCH ₂ OMe	N	CH	CH
II-253		OCOCH ₃	N	CH	CH
II-254		SCH ₃	N	CH	CH
II-255		SOCH ₃	N	CH	CH
II-256		SO ₂ CH ₃	N	CH	CH
II-257		SCF ₃	N	CH	CH
II-258		SOCF ₃	N	CH	CH
II-259		SO ₂ CF ₃	N	CH	CH
II-260		NH ₂	N	CH	CH
II-261		NHCH ₃	N	CH	CH
II-262		N(CH ₃) ₂	N	CH	CH

[0156]

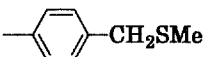
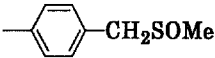
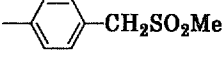
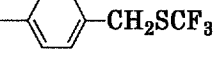
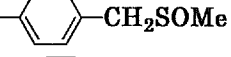
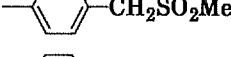
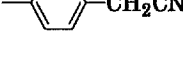
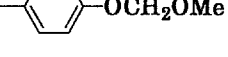
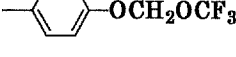
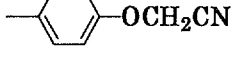
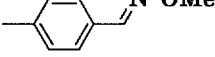
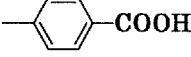
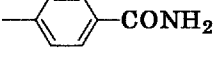
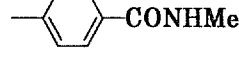
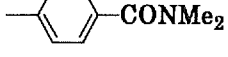
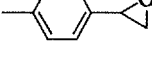
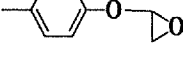
[表21]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-263		NHCOCH ₃	N	CH	CH
II-264		CH ₂ OH	N	CH	CH
II-265		CH ₂ OMe	N	CH	CH
II-266		CH ₂ SMe	N	CH	CH
II-267		CH ₂ SOMe	N	CH	CH
II-268		CH ₂ SO ₂ Me	N	CH	CH
II-269		CH ₂ SCF ₃	N	CH	CH
II-270		CH ₂ SOCF ₃	N	CH	CH
II-271		CH ₂ SO ₂ CF ₃	N	CH	CH
II-272		CH ₂ CN	N	CH	CH
II-273		CH ₂ CH=NOCH ₃	N	CH	CH
II-274		CO ₂ H	N	CH	CH
II-275		CO ₂ Me	N	CH	CH
II-276		CONH ₂	N	CH	CH
II-277		CONHMe	N	CH	CH
II-278		CONMe ₂	N	CH	CH
II-279			N	CH	CH
II-280	(4-NO ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-281	(4-CN)Ph	H	N	CH	CH
II-282	(4-CH ₂ =CHCH ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-283	(4-CH≡CCH ₂)Ph	H	N	CH	CH

[0157] [表22]

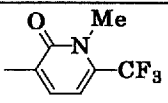
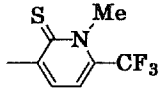
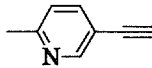
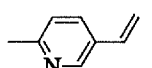
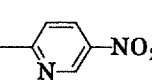
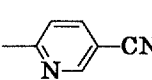
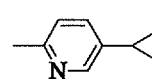
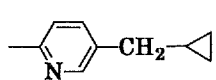
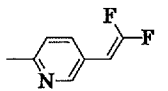
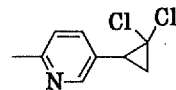
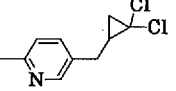
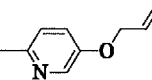
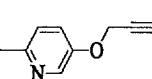
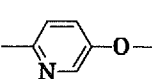
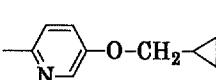
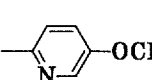
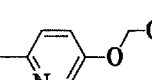
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-284	(4-c-Pr)Ph	H	N	CH	CH
II-285	(4-OCHF ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-286	(4-SMe)Ph	H	N	CH	CH
II-287	(4-SOMe)Ph	H	N	CH	CH
II-288	(4-SO ₂ Me)Ph	H	N	CH	CH
II-289	(4-SCF ₃)Ph	H	N	CH	CH
II-290	(4-SOCF ₃)Ph	H	N	CH	CH
II-291	(4-SO ₂ CF ₃)Ph	H	N	CH	CH
II-292	(4-CO ₂ Me)Ph	H	N	CH	CH
II-293	(4-COMe)Ph	H	N	CH	CH
II-294	(4-CH ₂ OMe)Ph	H	N	CH	CH
II-295	(4-CH ₂ c-Pr)Ph	H	N	CH	CH
II-296	(4-CH ₂ CH=CF ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-297	(4-CH ₂ CH≡CF)Ph	H	N	CH	CH
II-298		H	N	CH	CH
II-299		H	N	CH	CH
II-300		H	N	CH	CH
II-301		H	N	CH	CH
II-302		H	N	CH	CH
II-303		H	N	CH	CH
II-304		H	N	CH	CH
II-305		H	N	CH	CH
II-306		H	N	CH	CH
II-307		H	N	CH	CH
II-308		H	N	CH	CH

[0158] [表23]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-309		H	N	CH	CH
II-310		H	N	CH	CH
II-311		H	N	CH	CH
II-312		H	N	CH	CH
II-313		H	N	CH	CH
II-314		H	N	CH	CH
II-315		H	N	CH	CH
II-316		H	N	CH	CH
II-317		H	N	CH	CH
II-318		H	N	CH	CH
II-319		H	N	CH	CH
II-320		H	N	CH	CH
II-321		H	N	CH	CH
II-322		H	N	CH	CH
II-323		H	N	CH	CH
II-324		H	N	CH	CH
II-325		H	N	CH	CH

[0159]

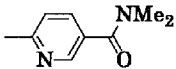
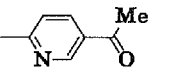
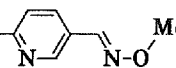
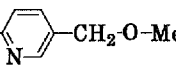
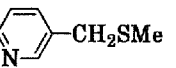
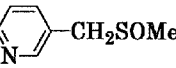
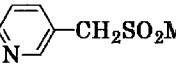
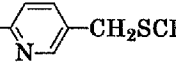
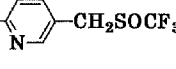
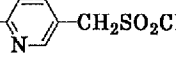
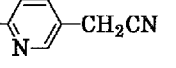
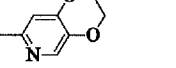
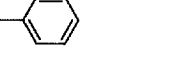
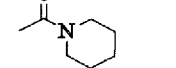
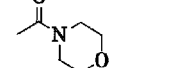
[表24]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-326		H	N	CH	CH
II-327		H	N	CH	CH
II-328		H	N	CH	CH
II-329		H	N	CH	CH
II-330		H	N	CH	CH
II-331		H	N	CH	CH
II-332		H	N	CH	CH
II-333		H	N	CH	CH
II-334		H	N	CH	CH
II-335		H	N	CH	CH
II-336		H	N	CH	CH
II-337		H	N	CH	CH
II-338		H	N	CH	CH
II-339		H	N	CH	CH
II-340		H	N	CH	CH
II-341		H	N	CH	CH
II-342		H	N	CH	CH

[表25]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-343		H	N	CH	CH
II-344		H	N	CH	CH
II-345		H	N	CH	CH
II-346		H	N	CH	CH
II-347		H	N	CH	CH
II-348		H	N	CH	CH
II-349		H	N	CH	CH
II-350		H	N	CH	CH
II-351		H	N	CH	CH
II-352		H	N	CH	CH
II-353		H	N	CH	CH
II-354		H	N	CH	CH
II-355		H	N	CH	CH
II-356		H	N	CH	CH
II-357		H	N	CH	CH
II-358		H	N	CH	CH
II-359		H	N	CH	CH

[0161] [表26]

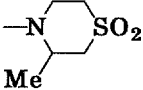
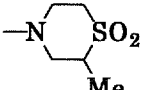
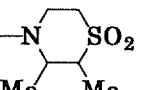
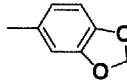
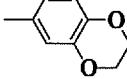
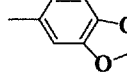
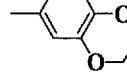
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-360		H	N	CH	CH
II-361		H	N	CH	CH
II-362		H	N	CH	CH
II-363		H	N	CH	CH
II-364		H	N	CH	CH
II-365		H	N	CH	CH
II-366		H	N	CH	CH
II-367		H	N	CH	CH
II-368		H	N	CH	CH
II-369		H	N	CH	CH
II-370		H	N	CH	CH
II-371		H	N	CH	CH
II-372		H	N	C-O-C ₂ H ₄ -O-C	
II-373		H	N	CH	CH
II-374		H	N	CH	CH
II-375	NHCO ₂ CH ₃	H	N	CH	CH
II-376	NHCO ₂ Bn	H	N	CH	CH
II-377	N(Me)CO ₂ Bn	H	N	CH	CH
II-378	N(Et)CO ₂ Bn	H	N	CH	CH
II-379	N(Pr)CO ₂ Bn	H	N	CH	CH
II-380	N(Me)CO ₂ Me	H	N	CH	CH

[0162]

[表27]

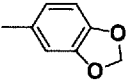
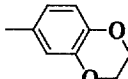
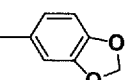
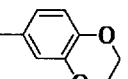
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-381	N(Et)CO ₂ Me	H	N	CH	CH
II-382	N(Pr)CO ₂ Me	H	N	CH	CH
II-383	NHCO ₂ Et	H	N	CH	CH
II-384	N(Me)CO ₂ Et	H	N	CH	CH
II-385	N(Et)CO ₂ Et	H	N	CH	CH
II-386	N(Pr)CO ₂ Et	H	N	CH	CH
II-387	NEt ₂	H	N	CH	CH
II-388	NPr ₂	H	N	CH	CH
II-389	(2,3-F ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-390	(2,4-F ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-391	(2,5-F ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-392	(2,6-F ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-393	(3,4-F ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-394	(3,5-F ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-395	(2,3-Cl ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-396	(2,4-Cl ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-397	(2,5-Cl ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-398	(2,6-Cl ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-399	(3,4-Cl ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-400	(3,5-Cl ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-401	(2-F, 3-OMe)Ph	H	N	CH	CH
II-402	(2-Cl, 3-OMe)Ph	H	N	CH	CH
II-403	(2-Me, 3-OMe)Ph	H	N	CH	CH
II-404	(2-Cl, 4-Me)Ph	H	N	CH	CH
II-405	(2-Cl, 4-OMe)Ph	H	N	CH	CH
II-406	(2,3-(OMe) ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-407	(3-OMe, 4-F)Ph	H	N	CH	CH
II-408	(3-OMe, 4-Cl)Ph	H	N	CH	CH
II-409	(3-OMe, 4-Me)Ph	H	N	CH	CH
II-410	(3,4-(OMe) ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-411	(3-OMe, 5-F)Ph	H	N	CH	CH
II-412	(3-OMe, 5-Cl)Ph	H	N	CH	CH
II-413	(3-OMe, 5-Me)Ph	H	N	CH	CH
II-414	(3,5-(OMe) ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-415	(2-F, 4-Me)Ph	H	N	CH	CH
II-416	(2-F, 4-OMe)Ph	H	N	CH	CH
II-417	(2-Cl, 4-OMe)Ph	H	N	CH	CH
II-418	(2-Me, 4-OMe)Ph	H	N	CH	CH
II-419	(2,4-(OMe) ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-420	(3-F, 4-Me)Ph	H	N	CH	CH
II-421	(3-F, 4-OMe)Ph	H	N	CH	CH
II-422	(3-Cl, 4-Me)Ph	H	N	CH	CH

[0163] [表28]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-423	(3-Cl, 4-OMe)Ph	H	N	CH	CH
II-424	(3-Me, 4-OMe)Ph	H	N	CH	CH
II-425	(2-F, 5-OMe)Ph	H	N	CH	CH
II-426	(2-Cl, 5-OMe)Ph	H	N	CH	CH
II-427	(2-Me, 5-OMe)Ph	H	N	CH	CH
II-428	(2,5-(OMe) ₂)Ph	H	N	CH	CH
II-429	(3,4,5-(OMe) ₃)Ph	H	N	CH	CH
II-430		H	N	CH	CH
II-431		H	N	CH	CH
II-432		H	N	CH	CH
II-433		H	N	CH	CH
II-434	Me	Et	N	CH	CH
II-435	Et	Et	N	CH	CH
II-436	Ph	Et	N	CH	CH
II-437	Bn	Et	N	CH	CH
II-438	(4-OMe)Ph	Et	N	CH	CH
II-439		Et	N	CH	CH
II-440		Et	N	CH	CH
II-441		CHF ₂	N	CH	CH
II-442		CHF ₂	N	CH	CH
II-443	Me	CF ₂ CF ₃	N	CH	CH
II-444	Et	CF ₂ CF ₃	N	CH	CH
II-445	Ph	CF ₂ CF ₃	N	CH	CH
II-446	Bn	CF ₂ CF ₃	N	CH	CH
II-447	(4-OMe)Ph	CF ₂ CF ₃	N	CH	CH

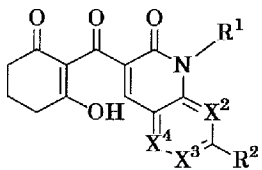
[0164]

[表29]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
II-448		CF ₂ CF ₃	N	CH	CH
II-449		CF ₂ CF ₃	N	CH	CH
II-450	Me	H	N	CCH ₃	CH
II-451	Et	H	N	CCH ₃	CH
II-452	Ph	H	N	CCH ₃	CH
II-453	Bn	H	N	CCH ₃	CH
II-454	(4-OMe)Ph	H	N	CCH ₃	CH
II-455		H	N	CCH ₃	CH
II-456		H	N	CCH ₃	CH
II-457	(3-F-4-Me)Ph	H	N	CH	CH

[0165]

[表30]

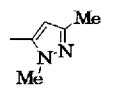
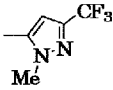
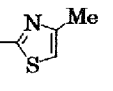
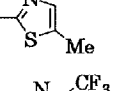
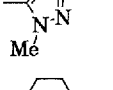
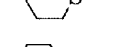
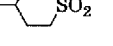
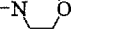
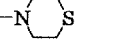
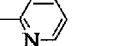
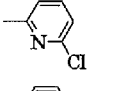
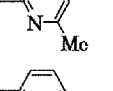
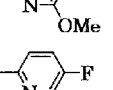
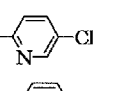
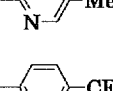
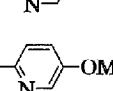
					
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
III-1	H	H	CH	CH	N
III-2	Me	H	CH	CH	N
III-3	Et	H	CH	CH	N
III-4	n-Pr	H	CH	CH	N
III-5	i-Pr	H	CH	CH	N
III-6	c-Pr	H	CH	CH	N
III-7	n-Bu	H	CH	CH	N
III-8	i-Bu	H	CH	CH	N
III-9	t-Bu	H	CH	CH	N
III-10	c-Pen	H	CH	CH	N
III-11	CH ₂ CH=CH ₂	H	CH	CH	N
III-12	CH ₂ C≡CH	H	CH	CH	N
III-13	CH ₂ CF ₃	H	CH	CH	N
III-14	C ₂ H ₄ OCH ₃	H	CH	CH	N
III-15	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	H	CH	CH	N
III-16	CH(Me)OEt	H	CH	CH	N
III-17	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CH	CH	N
III-18	CH ₂ SMe	H	CH	CH	N
III-19	CH ₂ SEt	H	CH	CH	N
III-20	CH ₂ SOMe	H	CH	CH	N
III-21	CH ₂ SOEt	H	CH	CH	N
III-22	CH ₂ SO ₂ Me	H	CH	CH	N
III-23	CH ₂ SO ₂ Et	H	CH	CH	N
III-24	Bn	H	CH	CH	N
III-25	(2-F)Bn	H	CH	CH	N
III-26	(3-F)Bn	H	CH	CH	N
III-27	(4-F)Bn	H	CH	CH	N
III-28	(2-Cl)Bn	H	CH	CH	N
III-29	(3-Cl)Bn	H	CH	CH	N
III-30	(4-Cl)Bn	H	CH	CH	N
III-31	(2-Me)Bn	H	CH	CH	N
III-32	(3-Me)Bn	H	CH	CH	N
III-33	(4-Me)Bn	H	CH	CH	N
III-34	(2-CF ₃)Bn	H	CH	CH	N

[0166]

[表31]

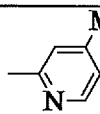
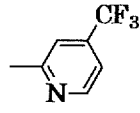
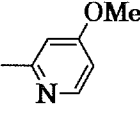
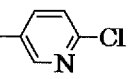
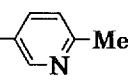
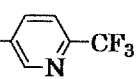
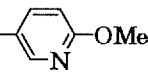
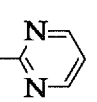
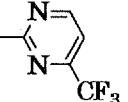
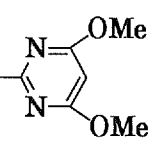
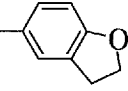
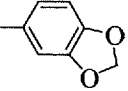
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
III-35	(3-CF ₃)Bn	H	CH	CH	N
III-36	(4-CF ₃)Bn	H	CH	CH	N
III-37	(2-OMe)Bn	H	CH	CH	N
III-38	(3-OMe)Bn	H	CH	CH	N
III-39	(4-OMe)Bn	H	CH	CH	N
III-40	CH(Me)Ph	H	CH	CH	N
III-41	Ph	H	CH	CH	N
III-42	(2-F)Ph	H	CH	CH	N
III-43	(3-F)Ph	H	CH	CH	N
III-44	(4-F)Ph	H	CH	CH	N
III-45	(2-Cl)Ph	H	CH	CH	N
III-46	(3-Cl)Ph	H	CH	CH	N
III-47	(4-Cl)Ph	H	CH	CH	N
III-48	(2-Me)Ph	H	CH	CH	N
III-49	(3-Me)Ph	H	CH	CH	N
III-50	(4-Me)Ph	H	CH	CH	N
III-51	(2-CF ₃)Ph	H	CH	CH	N
III-52	(3-CF ₃)Ph	H	CH	CH	N
III-53	(4-CF ₃)Ph	H	CH	CH	N
III-54	(2-OMe)Ph	H	CH	CH	N
III-55	(3-OMe)Ph	H	CH	CH	N
III-56	(4-OMe)Ph	H	CH	CH	N
III-57	(3-F-4-OMe)Ph	H	CH	CH	N
III-58	(3-F-4-Me)Ph	H	CH	CH	N
III-59	(4-F-3-Me)Ph	H	CH	CH	N
III-60		H	CH	CH	N
III-61		H	CH	CH	N
III-62		H	CH	CH	N
III-63		H	CH	CH	N
III-64		H	CH	CH	N
III-65		H	CH	CH	N
III-66		H	CH	CH	N

[0167] [表32]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
III-67		H	CH	CH	N
III-68		H	CH	CH	N
III-69		H	CH	CH	N
III-70		H	CH	CH	N
III-71		H	CH	CH	N
III-72		H	CH	CH	N
III-73		H	CH	CH	N
III-74		H	CH	CH	N
III-75		H	CH	CH	N
III-76		H	CH	CH	N
III-77		H	CH	CH	N
III-78		H	CH	CH	N
III-79		H	CH	CH	N
III-80		H	CH	CH	N
III-81		H	CH	CH	N
III-82		H	CH	CH	N
III-83		H	CH	CH	N
III-84		H	CH	CH	N

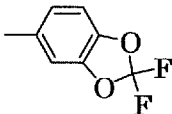
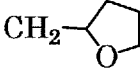
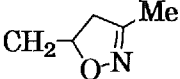
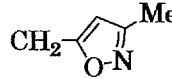
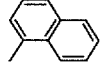
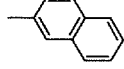
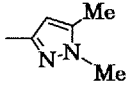
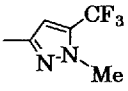
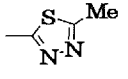
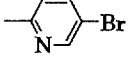
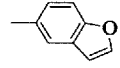
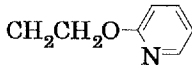
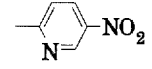
[0168]

[表33]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
III-85		H	CH	CH	N
III-86		H	CH	CH	N
III-87		H	CH	CH	N
III-88		H	CH	CH	N
III-89		H	CH	CH	N
III-90		H	CH	CH	N
III-91		H	CH	CH	N
III-92		H	CH	CH	N
III-93		H	CH	CH	N
III-94		H	CH	CH	N
III-95		H	CH	CH	N
III-96		H	CH	CH	N
III-97		H	CH	CH	N
III-98		H	CH	CH	N

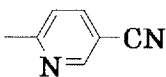
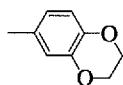
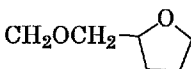
[0169]

[表34]

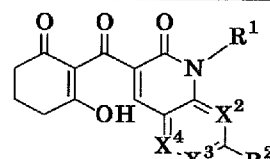
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
III-99		H	CH	CH	N
III-100		H	CH	CH	N
III-101		H	CH	CH	N
III-102		H	CH	CH	N
III-103	NH ₂	H	CH	CH	N
III-104	NHMe	H	CH	CH	N
III-105	OMe	H	CH	CH	N
III-106	OEt	H	CH	CH	N
III-107	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CH	CH	N
III-108		H	CH	CH	N
III-109		H	CH	CH	N
III-110		H	CH	CH	N
III-111		H	CH	CH	N
III-112		H	CH	CH	N
III-113		H	CH	CH	N
III-114		H	CH	CH	N
III-115		H	CH	CH	N
III-116		H	CH	CH	N

[0170]

[表35]

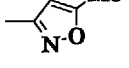
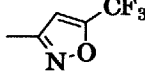
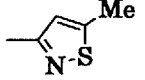
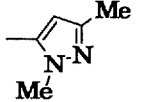
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
III-117		H	CH	CH	N
III-118		H	CH	CH	N
III-119		H	CH	CH	N
III-120	CH ₂ CN	H	CH	CH	N
III-121	Me	Me	CH	CH	N
III-122	Et	Me	CH	CH	N
III-123	Ph	Me	CH	CH	N
III-124	Bn	Me	CH	CH	N
III-125	(4-OMe)Ph	Me	CH	CH	N
III-126	Me	Et	CH	CH	N
III-127	Et	Et	CH	CH	N
III-128	Ph	Et	CH	CH	N
III-129	Bn	Et	CH	CH	N
III-130	(4-OMe)Ph	Et	CH	CH	N
III-131	Me	i-Pr	CH	CH	N
III-132	Et	i-Pr	CH	CH	N
III-133	Ph	i-Pr	CH	CH	N
III-134	Bn	i-Pr	CH	CH	N
III-135	(4-OMe)Ph	i-Pr	CH	CH	N
III-136	Me	CF ₃	CH	CH	N
III-137	Et	CF ₃	CH	CH	N
III-138	Ph	CF ₃	CH	CH	N
III-139	Bn	CF ₃	CH	CH	N
III-140	(4-OMe)Ph	CF ₃	CH	CH	N
III-141	Me	CF ₂ Cl	CH	CH	N
III-142	Et	CF ₂ Cl	CH	CH	N
III-143	Ph	CF ₂ Cl	CH	CH	N
III-144	Bn	CF ₂ Cl	CH	CH	N
III-145	(4-OMe)Ph	CF ₂ Cl	CH	CH	N
III-146	Me	OCH ₃	CH	CH	N
III-147	Et	OCH ₃	CH	CH	N
III-148	Ph	OCH ₃	CH	CH	N
III-149	Bn	OCH ₃	CH	CH	N
III-150	(4-OMe)Ph	OCH ₃	CH	CH	N

[0171] [表36]

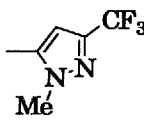
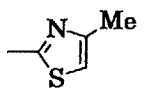
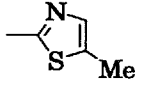
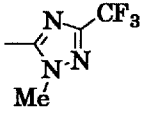
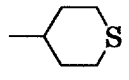
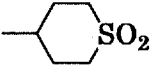
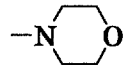
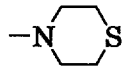
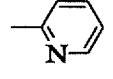
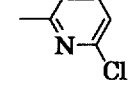
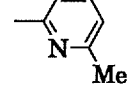
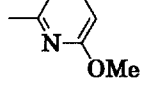
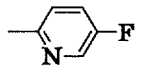
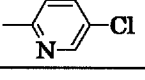
					
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
IV-1	H	H	N	N	CH
IV-2	Me	H	N	N	CH
IV-3	Et	H	N	N	CH
IV-4	n-Pr	H	N	N	CH
IV-5	i-Pr	H	N	N	CH
IV-6	c-Pr	H	N	N	CH
IV-7	n-Bu	H	N	N	CH
IV-8	i-Bu	H	N	N	CH
IV-9	t-Bu	H	N	N	CH
IV-10	c-Pen	H	N	N	CH
IV-11	CH ₂ CH=CH ₂	H	N	N	CH
IV-12	CH ₂ C≡CH	H	N	N	CH
IV-13	CH ₂ CF ₃	H	N	N	CH
IV-14	C ₂ H ₄ OCH ₃	H	N	N	CH
IV-15	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	H	N	N	CH
IV-16	CH(Me)OEt	H	N	N	CH
IV-17	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	N	N	CH
IV-18	CH ₂ SMe	H	N	N	CH
IV-19	CH ₂ SEt	H	N	N	CH
IV-20	CH ₂ SOMe	H	N	N	CH
IV-21	CH ₂ SOEt	H	N	N	CH
IV-22	CH ₂ SO ₂ Me	H	N	N	CH
IV-23	CH ₂ SO ₂ Et	H	N	N	CH
IV-24	Bn	H	N	N	CH
IV-25	(2-F)Bn	H	N	N	CH
IV-26	(3-F)Bn	H	N	N	CH
IV-27	(4-F)Bn	H	N	N	CH
IV-28	(2-Cl)Bn	H	N	N	CH
IV-29	(3-Cl)Bn	H	N	N	CH
IV-30	(4-Cl)Bn	H	N	N	CH
IV-31	(2-Me)Bn	H	N	N	CH
IV-32	(3-Me)Bn	H	N	N	CH
IV-33	(4-Me)Bn	H	N	N	CH
IV-34	(2-CF ₃)Bn	H	N	N	CH
IV-35	(3-CF ₃)Bn	H	N	N	CH
IV-36	(4-CF ₃)Bn	H	N	N	CH
IV-37	(2-OMe)Bn	H	N	N	CH

[0172]

[表37]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
IV-38	(3-OMe)Bn	H	N	N	CH
IV-39	(4-OMe)Bn	H	N	N	CH
IV-40	CH(Me)Ph	H	N	N	CH
IV-41	Ph	H	N	N	CH
IV-42	(2-F)Ph	H	N	N	CH
IV-43	(3-F)Ph	H	N	N	CH
IV-44	(4-F)Ph	H	N	N	CH
IV-45	(2-Cl)Ph	H	N	N	CH
IV-46	(3-Cl)Ph	H	N	N	CH
IV-47	(4-Cl)Ph	H	N	N	CH
IV-48	(2-Me)Ph	H	N	N	CH
IV-49	(3-Me)Ph	H	N	N	CH
IV-50	(4-Me)Ph	H	N	N	CH
IV-51	(2-CF ₃)Ph	H	N	N	CH
IV-52	(3-CF ₃)Ph	H	N	N	CH
IV-53	(4-CF ₃)Ph	H	N	N	CH
IV-54	(2-OMe)Ph	H	N	N	CH
IV-55	(3-OMe)Ph	H	N	N	CH
IV-56	(4-OMe)Ph	H	N	N	CH
IV-57	(3-F-4-OMe)Ph	H	N	N	CH
IV-58	(3-F-4-Me)Ph	H	N	N	CH
IV-59	(4-F-3-Me)Ph	H	N	N	CH
IV-60		H	N	N	CH
IV-61		H	N	N	CH
IV-62		H	N	N	CH
IV-63		H	N	N	CH
IV-64		H	N	N	CH
IV-65		H	N	N	CH
IV-66		H	N	N	CH
IV-67		H	N	N	CH

[0173] [表38]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
IV-68		H	N	N	CH
IV-69		H	N	N	CH
IV-70		H	N	N	CH
IV-71		H	N	N	CH
IV-72		H	N	N	CH
IV-73		H	N	N	CH
IV-74		H	N	N	CH
IV-75		H	N	N	CH
IV-76		H	N	N	CH
IV-77		H	N	N	CH
IV-78		H	N	N	CH
IV-79		H	N	N	CH
IV-80		H	N	N	CH
IV-81		H	N	N	CH

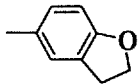
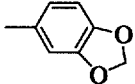
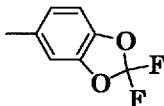
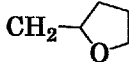
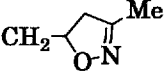
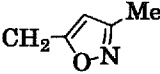
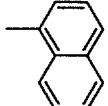
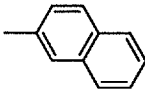
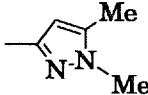
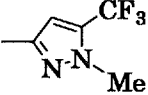
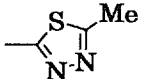
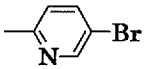
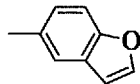
[0174]

[表39]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
IV-82		H	N	N	CH
IV-83		H	N	N	CH
IV-84		H	N	N	CH
IV-85		H	N	N	CH
IV-86		H	N	N	CH
IV-87		H	N	N	CH
IV-88		H	N	N	CH
IV-89		H	N	N	CH
IV-90		H	N	N	CH
IV-91		H	N	N	CH
IV-92		H	N	N	CH
IV-93		H	N	N	CH
IV-94		H	N	N	CH
IV-95		H	N	N	CH
IV-96		H	N	N	CH

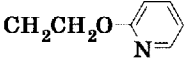
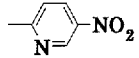
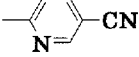
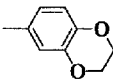
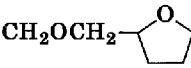
[0175]

[表40]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
IV-97		H	N	N	CH
IV-98		H	N	N	CH
IV-99		H	N	N	CH
IV-100		H	N	N	CH
IV-101		H	N	N	CH
IV-102		H	N	N	CH
IV-103	NH ₂	H	N	N	CH
IV-104	NHMe	H	N	N	CH
IV-105	OMe	H	N	N	CH
IV-106	OEt	H	N	N	CH
IV-107	CH ₂ CH ₂ OMe	H	N	N	CH
IV-108		H	N	N	CH
IV-109		H	N	N	CH
IV-110		H	N	N	CH
IV-111		H	N	N	CH
IV-112		H	N	N	CH
IV-113		H	N	N	CH
IV-114		H	N	N	CH

[0176]

[表41]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
IV-115		H	N	N	CH
IV-116		H	N	N	CH
IV-117		H	N	N	CH
IV-118		H	N	N	CH
IV-119		H	N	N	CH
IV-120	CH ₂ CN	H	N	N	CH
IV-121	Me	Me	N	N	CH
IV-122	Et	Me	N	N	CH
IV-123	Ph	Me	N	N	CH
IV-124	Bn	Me	N	N	CH
IV-125	(4-OMe)Ph	Me	N	N	CH
IV-126	Me	Et	N	N	CH
IV-127	Et	Et	N	N	CH
IV-128	Ph	Et	N	N	CH
IV-129	Bn	Et	N	N	CH
IV-130	(4-OMe)Ph	Et	N	N	CH
IV-131	Me	i-Pr	N	N	CH
IV-132	Et	i-Pr	N	N	CH
IV-133	Ph	i-Pr	N	N	CH
IV-134	Bn	i-Pr	N	N	CH
IV-135	(4-OMe)Ph	i-Pr	N	N	CH
IV-136	Me	CF ₃	N	N	CH
IV-137	Et	CF ₃	N	N	CH
IV-138	Ph	CF ₃	N	N	CH
IV-139	Bn	CF ₃	N	N	CH
IV-140	(4-OMe)Ph	CF ₃	N	N	CH
IV-141	Me	CF ₂ Cl	N	N	CH
IV-142	Et	CF ₂ Cl	N	N	CH
IV-143	Ph	CF ₂ Cl	N	N	CH
IV-144	Bn	CF ₂ Cl	N	N	CH
IV-145	(4-OMe)Ph	CF ₂ Cl	N	N	CH
IV-146	Me	OCH ₃	N	N	CH
IV-147	Et	OCH ₃	N	N	CH
IV-148	Ph	OCH ₃	N	N	CH
IV-149	Bn	OCH ₃	N	N	CH

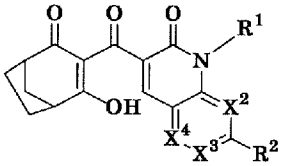
[0177]

[表42]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
IV-150	(4-OMe)Ph	OCH ₃	N	N	CH
IV-151	Me	H	N	N	CCH ₃
IV-152	Et	H	N	N	CCH ₃
IV-153	Ph	H	N	N	CCH ₃
IV-154	Bn	H	N	N	CCH ₃
IV-155	(4-OMe)Ph	H	N	N	CCH ₃
IV-156	Me	H	N	N	CCl
IV-157	Et	H	N	N	CCl
IV-158	Ph	H	N	N	CCl
IV-159	Bn	H	N	N	CCl
IV-160	(4-OMe)Ph	H	N	N	CCl
IV-161	Me	H	N	N	CF
IV-162	Et	H	N	N	CF
IV-163	Ph	H	N	N	CF
IV-164	Bn	H	N	N	CF
IV-165	(4-OMe)Ph	H	N	N	CF
IV-166	Me	H	N	N	CBr
IV-167	Et	H	N	N	CBr
IV-168	Ph	H	N	N	CBr
IV-169	Bn	H	N	N	CBr
IV-170	(4-OMe)Ph	H	N	N	CBr

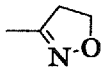
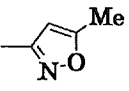
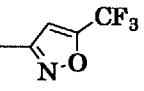
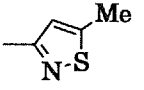
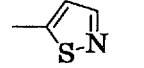
[0178]

[表43]

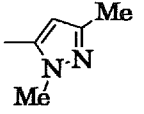
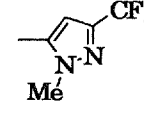
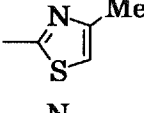
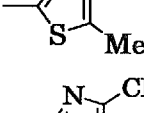
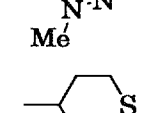
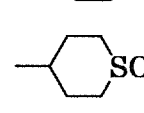
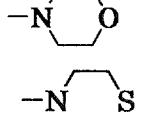
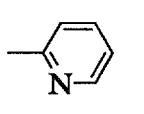
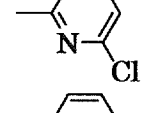
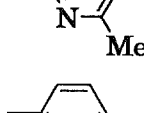
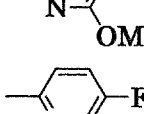
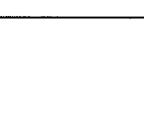
					
化合物番号	R¹	R²	X²	X³	X⁴
V-1	H	H	N	CH	CH
V-2	Me	H	N	CH	CH
V-3	Et	H	N	CH	CH
V-4	n-Pr	H	N	CH	CH
V-5	i-Pr	H	N	CH	CH
V-6	c-Pr	H	N	CH	CH
V-7	n-Bu	H	N	CH	CH
V-8	i-Bu	H	N	CH	CH
V-9	t-Bu	H	N	CH	CH
V-10	c-Pen	H	N	CH	CH
V-11	CH₂CH=CH₂	H	N	CH	CH
V-12	CH₂C≡CH	H	N	CH	CH
V-13	CH₂CF₃	H	N	CH	CH
V-14	C₂H₄OCH₃	H	N	CH	CH
V-15	C₂H₄OC₂H₅	H	N	CH	CH
V-16	CH(Me)OEt	H	N	CH	CH
V-17	CH₂OCH₂CF₃	H	N	CH	CH
V-18	CH₂SMe	H	N	CH	CH
V-19	CH₂SEt	H	N	CH	CH
V-20	CH₂SOMe	H	N	CH	CH
V-21	CH₂SOEt	H	N	CH	CH
V-22	CH₂SO₂Me	H	N	CH	CH
V-23	CH₂SO₂Et	H	N	CH	CH
V-24	Bn	H	N	CH	CH
V-25	(2-F)Bn	H	N	CH	CH
V-26	(3-F)Bn	H	N	CH	CH
V-27	(4-F)Bn	H	N	CH	CH
V-28	(2-Cl)Bn	H	N	CH	CH
V-29	(3-Cl)Bn	H	N	CH	CH
V-30	(4-Cl)Bn	H	N	CH	CH
V-31	(2-Me)Bn	H	N	CH	CH
V-32	(3-Me)Bn	H	N	CH	CH
V-33	(4-Me)Bn	H	N	CH	CH
V-34	(2-CF₃)Bn	H	N	CH	CH
V-35	(3-CF₃)Bn	H	N	CH	CH
V-36	(4-CF₃)Bn	H	N	CH	CH

[0179]

[表44]

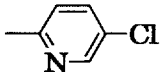
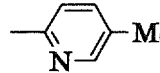
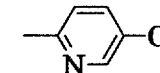
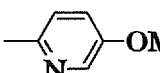
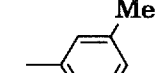
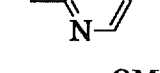
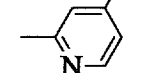
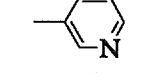
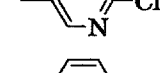
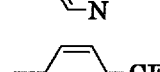
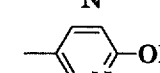
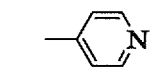
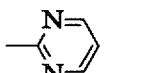
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
V-37	(2-OMe)Bn	H	N	CH	CH
V-38	(3-OMe)Bn	H	N	CH	CH
V-39	(4-OMe)Bn	H	N	CH	CH
V-40	CH(Me)Ph	H	N	CH	CH
V-41	Ph	H	N	CH	CH
V-42	(2-F)Ph	H	N	CH	CH
V-43	(3-F)Ph	H	N	CH	CH
V-44	(4-F)Ph	H	N	CH	CH
V-45	(2-Cl)Ph	H	N	CH	CH
V-46	(3-Cl)Ph	H	N	CH	CH
V-47	(4-Cl)Ph	H	N	CH	CH
V-48	(2-Me)Ph	H	N	CH	CH
V-49	(3-Me)Ph	H	N	CH	CH
V-50	(4-Me)Ph	H	N	CH	CH
V-51	(2-CF ₃)Ph	H	N	CH	CH
V-52	(3-CF ₃)Ph	H	N	CH	CH
V-53	(4-CF ₃)Ph	H	N	CH	CH
V-54	(2-OMe)Ph	H	N	CH	CH
V-55	(3-OMe)Ph	H	N	CH	CH
V-56	(4-OMe)Ph	H	N	CH	CH
V-57	(3-F-4-OMe)Ph	H	N	CH	CH
V-58	(2,5-Me ₂)Ph	H	N	CH	CH
V-59	(4-F-3-Me)Ph	H	N	CH	CH
V-60		H	N	CH	CH
V-61		H	N	CH	CH
V-62		H	N	CH	CH
V-63		H	N	CH	CH
V-64		H	N	CH	CH
V-65		H	N	CH	CH
V-66		H	N	CH	CH

[0180] [表45]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
V-67		H	N	CH	CH
V-68		H	N	CH	CH
V-69		H	N	CH	CH
V-70		H	N	CH	CH
V-71		H	N	CH	CH
V-72		H	N	CH	CH
V-73		H	N	CH	CH
V-74		H	N	CH	CH
V-75		H	N	CH	CH
V-76		H	N	CH	CH
V-77		H	N	CH	CH
V-78		H	N	CH	CH
V-79		H	N	CH	CH
V-80		H	N	CH	CH

[0181]

[表46]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
V-81		H	N	CH	CH
V-82		H	N	CH	CH
V-83		H	N	CH	CH
V-84		H	N	CH	CH
V-85		H	N	CH	CH
V-86		H	N	CH	CH
V-87		H	N	CH	CH
V-88		H	N	CH	CH
V-89		H	N	CH	CH
V-90		H	N	CH	CH
V-91		H	N	CH	CH
V-92		H	N	CH	CH
V-93		H	N	CH	CH
V-94		H	N	CH	CH

[0182]

[表47]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
V-95		H	N	CH	CH
V-96		H	N	CH	CH
V-97		H	N	CH	CH
V-98		H	N	CH	CH
V-99		H	N	CH	CH
V-100		H	N	CH	CH
V-101		H	N	CH	CH
V-102		H	N	CH	CH
V-103	NH ₂	H	N	CH	CH
V-104	NHMe	H	N	CH	CH
V-105	OMe	H	N	CH	CH
V-106	OEt	H	N	CH	CH
V-107	CH ₂ CH ₂ OMe	H	N	CH	CH
V-108		H	N	CH	CH
V-109		H	N	CH	CH
V-110		H	N	CH	CH
V-111		H	N	CH	CH

[0183]

[表48]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
V-112		H	N	CH	CH
V-113		H	N	CH	CH
V-114		H	N	CH	CH
V-115		H	N	CH	CH
V-116		H	N	CH	CH
V-117		H	N	CH	CH
V-118		H	N	CH	CH
V-119		H	N	CH	CH
V-120	CH ₂ CN	H	N	CH	CH
V-121	Me	Me	N	CH	CH
V-122	Et	Me	N	CH	CH
V-123	Ph	Me	N	CH	CH
V-124	Bn	Me	N	CH	CH
V-125	(4-OMe)Ph	Me	N	CH	CH
V-126	Me	Et	N	CH	CH
V-127	Et	Et	N	CH	CH
V-128	Ph	Et	N	CH	CH
V-129	Bn	Et	N	CH	CH
V-130	(4-OMe)Ph	Et	N	CH	CH
V-131	Me	i-Pr	N	CH	CH
V-132	Et	i-Pr	N	CH	CH
V-133	Ph	i-Pr	N	CH	CH
V-134	Bn	i-Pr	N	CH	CH
V-135	(4-OMe)Ph	i-Pr	N	CH	CH
V-136	Me	CF ₃	N	CH	CH
V-137	Et	CF ₃	N	CH	CH
V-138	Ph	CF ₃	N	CH	CH
V-139	Bn	CF ₃	N	CH	CH
V-140	(4-OMe)Ph	CF ₃	N	CH	CH
V-141	Me	CF ₂ Cl	N	CH	CH
V-142	Et	CF ₂ Cl	N	CH	CH
V-143	Ph	CF ₂ Cl	N	CH	CH

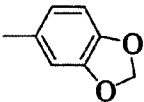
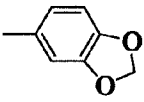
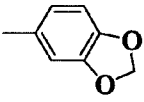
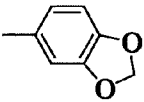
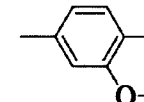
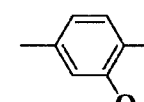
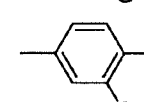
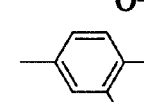
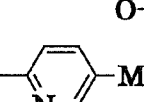
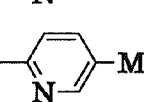
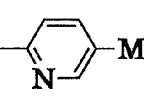
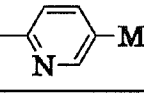
[0184]

[表49]

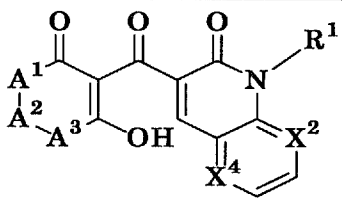
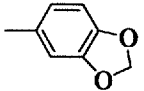
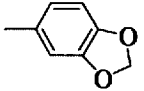
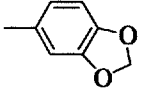
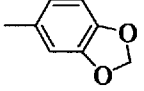
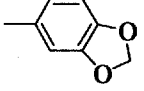
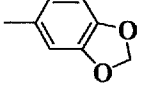
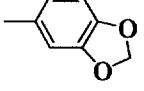
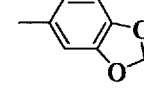
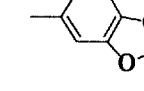
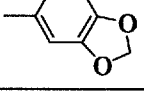
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
V-144	Bn	CF ₂ Cl	N	CH	CH
V-145	(4-OMe)Ph	CF ₂ Cl	N	CH	CH
V-146	Me	OCH ₃	N	CH	CH
V-147	Et	OCH ₃	N	CH	CH
V-148	Ph	OCH ₃	N	CH	CH
V-149	Bn	OCH ₃	N	CH	CH
V-150	(4-OMe)Ph	OCH ₃	N	CH	CH
V-151	Me	H	N	CH	CCH ₃
V-152	Et	H	N	CH	CCH ₃
V-153	Ph	H	N	CH	CCH ₃
V-154	Bn	H	N	CH	CCH ₃
V-155	(4-OMe)Ph	H	N	CH	CCH ₃
V-156	Me	H	N	CH	CCl
V-157	Et	H	N	CH	CCl
V-158	Ph	H	N	CH	CCl
V-159	Bn	H	N	CH	CCl
V-160	(4-OMe)Ph	H	N	CH	CCl
V-161	Me	H	N	CH	CF
V-162	Et	H	N	CH	CF
V-163	Ph	H	N	CH	CF
V-164	Bn	H	N	CH	CF
V-165	(4-OMe)Ph	H	N	CH	CF
V-166	Me	H	N	CH	CBr
V-167	Et	H	N	CH	CBr
V-168	Ph	H	N	CH	CBr
V-169	Bn	H	N	CH	CBr
V-170	(4-OMe)Ph	H	N	CH	CBr
V-171	Me	H	N	N	CH
V-172	Et	H	N	N	CH
V-173	Ph	H	N	N	CH
V-174	Bn	H	N	N	CH
V-175	(4-OMe)Ph	H	N	N	CH
V-176	Me	H	CH	CH	CH
V-177	Et	H	CH	CH	CH
V-178	Ph	H	CH	CH	CH
V-179	Bn	H	CH	CH	CH
V-180	(4-OMe)Ph	H	CH	CH	CH
V-181	Me	H	N	N	CH
V-182	Et	H	N	N	CH
V-183	Ph	H	N	N	CH
V-184	Bn	H	N	N	CH

[0185]

[表50]

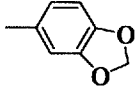
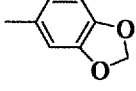
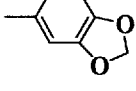
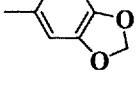
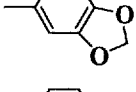
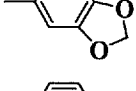
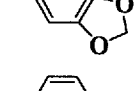
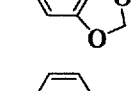
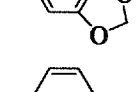
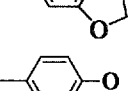
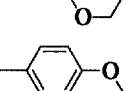
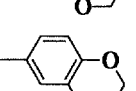
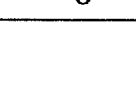
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
V-185	(4-OMe)Ph	H	N	CH	CH
V-186	Me	H	CH	CH	N
V-187	Et	H	CH	CH	N
V-188	Ph	H	CH	CH	N
V-189	Bn	H	CH	CH	N
V-190	(4-OMe)Ph	H	CH	CH	N
V-191		H	N	CH	CCH ₃
V-192		H	N	CH	CCl
V-193		H	N	CH	CF
V-194		H	N	CH	CBr
V-195		H	N	CH	CCH ₃
V-196		H	N	CH	CCl
V-197		H	N	CH	CF
V-198		H	N	CH	CBr
V-199		H	N	CH	CCH ₃
V-200		H	N	CH	CCl
V-201		H	CH	CH	CF
V-202		H	CH	CH	CBr

[0186] [表51]

						
化合物番号	R ¹	A ¹	A ²	A ³	X ²	X ⁴
VI-1		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CH
VI-2		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	N	CH
VI-3		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CCl
VI-4		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CF
VI-5		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CCH ₃
VI-6		CHCH ₃	CH ₂	CH ₂	CH	CH
VI-7		CH ₂	CHCH ₃	CH ₂	CH	CH
VI-8		CHCH ₃	CHCH ₃	CHCH ₃	CH	CH
VI-9		CHCH ₃	CH ₂	CH ₂	N	CH
VI-10		CH ₂	CHCH ₃	CH ₂	N	CH

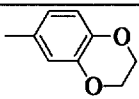
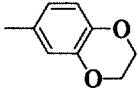
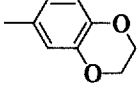
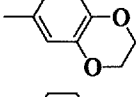
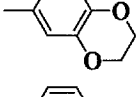
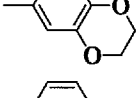
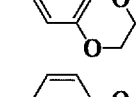
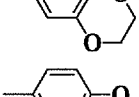
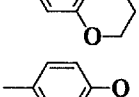
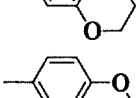
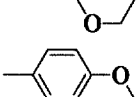
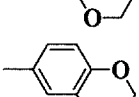
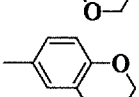
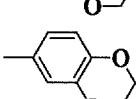
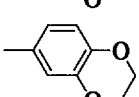
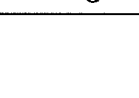
[0187]

[表52]

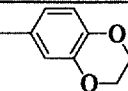
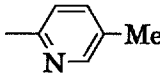
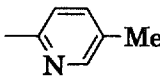
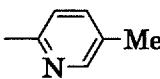
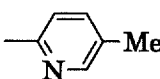
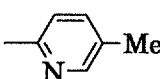
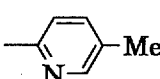
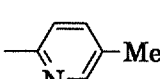
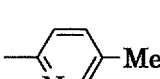
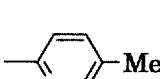
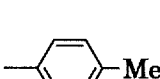
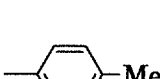
化合物番号	R ¹	A ¹	A ²	A ³	X ²	X ⁴
VI-11		CHCH ₃	CHCH ₃	CHCH ₃	N	CH
VI-12		C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂	CH	CH
VI-13		CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH	CH
VI-14		CHCH ₃	CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH	CH
VI-15		C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂	N	CH
VI-16		CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH ₂	N	CH
VI-17		CHCH ₃	CH ₂	C(CH ₃) ₂	N	CH
VI-18		CHCH ₃	CH ₂	CHCH ₃	CH	CH
VI-19		CHCH ₃	CHCH ₃	CH ₂	CH	CH
VI-20		CHCH ₃	CH ₂	CHCH ₃	N	CH
VI-21		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CH
VI-22		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	N	CH
VI-23		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CCl

[0188]

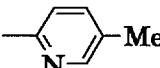
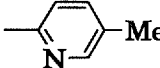
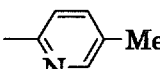
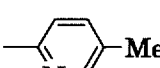
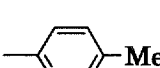
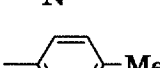
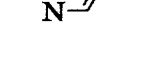
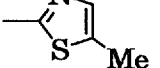
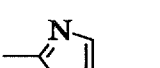
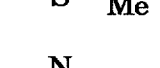
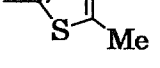
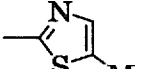
[表53]

化合物番号	R ¹	A ¹	A ²	A ³	X ²	X ⁴
VI-24		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CF
VI-25		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CCH ₃
VI-26		CHCH ₃	CH ₂	CH ₂	CH	CH
VI-27		CH ₂	CHCH ₃	CH ₂	CH	CH
VI-28		CHCH ₃	CHCH ₃	CHCH ₃	CH	CH
VI-29		CHCH ₃	CH ₂	CH ₂	N	CH
VI-30		CH ₂	CHCH ₃	CH ₂	N	CH
VI-31		CHCH ₃	CHCH ₃	CHCH ₃	N	CH
VI-32		C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂	CH	CH
VI-33		CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH	CH
VI-34		CHCH ₃	CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH	CH
VI-35		C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂	N	CH
VI-36		CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH ₂	N	CH
VI-37		CHCH ₃	CH ₂	C(CH ₃) ₂	N	CH
VI-38		CHCH ₃	CH ₂	CHCH ₃	CH	CH
VI-39		CHCH ₃	CHCH ₃	CH ₂	CH	CH

[0189] [表54]

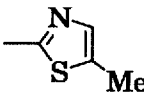
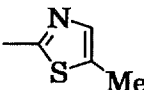
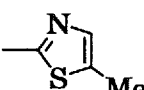
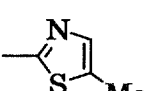
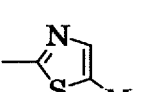
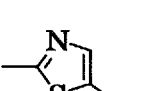
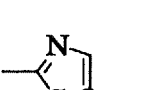
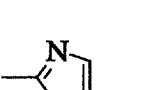
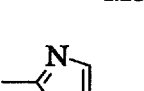
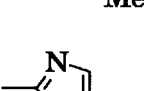
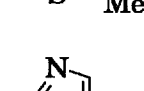
化合物番号	R ¹	A ¹	A ²	A ³	X ²	X ⁴
VI-40		CHCH ₃	CH ₂	CHCH ₃	N	CH
VI-41		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CH
VI-42		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	N	CH
VI-43		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CCl
VI-44		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CF
VI-45		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CCH ₃
VI-46		CHCH ₃	CH ₂	CH ₂	CH	CH
VI-47		CH ₂	CHCH ₃	CH ₂	CH	CH
VI-48		CHCH ₃	CHCH ₃	CHCH ₃	CH	CH
VI-49		CHCH ₃	CH ₂	CH ₂	N	CH
VI-50		CH ₂	CHCH ₃	CH ₂	N	CH
VI-51		CHCH ₃	CHCH ₃	CHCH ₃	N	CH
VI-52		C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂	CH	CH
VI-53		CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH	CH

[0190] [表55]

化合物番号	R ¹	A ¹	A ²	A ³	X ²	X ⁴
VI-54		CHCH ₃	CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH	CH
VI-55		C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂	N	CH
VI-56		CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH ₂	N	CH
VI-57		CHCH ₃	CH ₂	C(CH ₃) ₂	N	CH
VI-58		CHCH ₃	CH ₂	CHCH ₃	CH	CH
VI-59		CHCH ₃	CHCH ₃	CH ₂	CH	CH
VI-60		CHCH ₃	CH ₂	CHCH ₃	N	CH
VI-61		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CH
VI-62		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	N	CH
VI-63		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CCl
VI-64		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CF
VI-65		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CCH ₃
VI-66		CHCH ₃	CH ₂	CH ₂	CH	CH

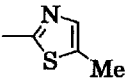
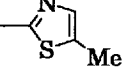
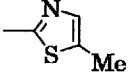
[0191]

[表56]

化合物番号	R ¹	A ¹	A ²	A ³	X ²	X ⁴
VI-67		CH ₂	CHCH ₃	CH ₂	CH	CH
VI-68		CHCH ₃	CHCH ₃	CHCH ₃	CH	CH
VI-69		CHCH ₃	CH ₂	CH ₂	N	CH
VI-70		CH ₂	CHCH ₃	CH ₂	N	CH
VI-71		CHCH ₃	CHCH ₃	CHCH ₃	N	CH
VI-72		C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂	CH	CH
VI-73		CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH	CH
VI-74		CHCH ₃	CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH	CH
VI-75		C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂	N	CH
VI-76		CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH ₂	N	CH
VI-77		CHCH ₃	CH ₂	C(CH ₃) ₂	N	CH

[0192]

[表57]

化合物番号	R ¹	A ¹	A ²	A ³	X ²	X ⁴
VI-78		CHCH ₃	CH ₂	CHCH ₃	CH	CH
VI-79		CHCH ₃	CHCH ₃	CH ₂	CH	CH
VI-80		CHCH ₃	CH ₂	CHCH ₃	N	CH
VI-81	(4-OMe)Ph	C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CH
VI-82	(4-OMe)Ph	C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	N	CH
VI-83	(4-OMe)Ph	C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CCl
VI-84	(4-OMe)Ph	C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CF
VI-85	(4-OMe)Ph	C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CCH ₃
VI-86	(4-OMe)Ph	CHCH ₃	CH ₂	CH ₂	CH	CH
VI-87	(4-OMe)Ph	CH ₂	CHCH ₃	CH ₂	CH	CH
VI-88	(4-OMe)Ph	CHCH ₃	CHCH ₃	CHCH ₃	CH	CH
VI-89	(4-OMe)Ph	CHCH ₃	CH ₂	CH ₂	N	CH
VI-90	(4-OMe)Ph	CH ₂	CHCH ₃	CH ₂	N	CH
VI-91	(4-Me)Ph	CHCH ₃	CHCH ₃	CHCH ₃	N	CH
VI-92	(4-Me)Ph	C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂	CH	CH
VI-93	(4-Me)Ph	CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH	CH
VI-94	(4-Me)Ph	CHCH ₃	CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH	CH
VI-95	(4-Me)Ph	C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂	N	CH
VI-96	(4-Me)Ph	CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH ₂	N	CH
VI-97	(4-Me)Ph	CHCH ₃	CH ₂	C(CH ₃) ₂	N	CH
VI-98	(4-Me)Ph	CHCH ₃	CH ₂	CHCH ₃	CH	CH
VI-99	(4-Me)Ph	CHCH ₃	CHCH ₃	CH ₂	CH	CH
VI-100	(4-Me)Ph	CHCH ₃	CH ₂	CHCH ₃	N	CH
VI-101	(3-F-4-Me)Ph	C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CH
VI-102	(3-F-4-Me)Ph	C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	N	CH
VI-103	(3-F-4-Me)Ph	C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CCl
VI-104	(3-F-4-Me)Ph	C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CF
VI-105	(3-F-4-Me)Ph	C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂	CH	CCH ₃
VI-106	(3-F-4-Me)Ph	CHCH ₃	CH ₂	CH ₂	CH	CH
VI-107	(3-F-4-Me)Ph	CH ₂	CHCH ₃	CH ₂	CH	CH
VI-108	(3-F-4-Me)Ph	CHCH ₃	CHCH ₃	CHCH ₃	CH	CH
VI-109	(3-F-4-Me)Ph	CHCH ₃	CH ₂	CH ₂	N	CH
VI-110	(3-F-4-Me)Ph	CH ₂	CHCH ₃	CH ₂	N	CH
VI-111	(3-F-4-OMe)Ph	CHCH ₃	CHCH ₃	CHCH ₃	N	CH

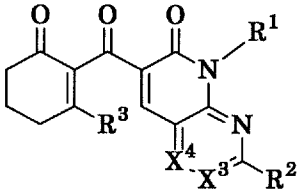
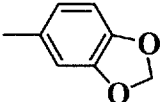
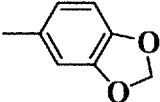
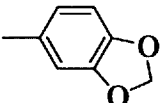
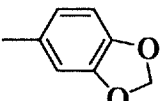
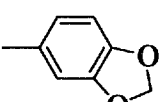
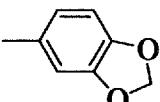
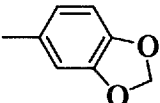
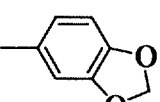
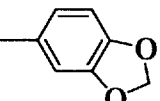
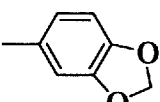
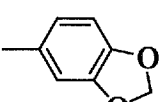
[0193]

[表58]

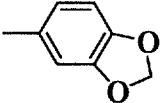
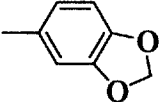
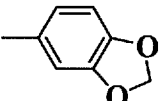
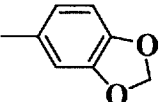
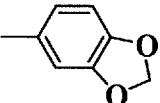
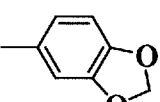
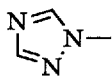
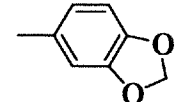
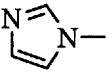
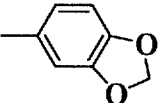
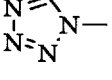
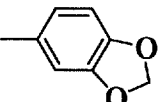
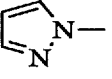
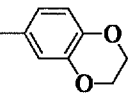
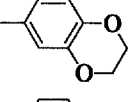
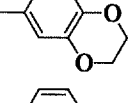
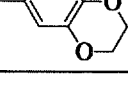
化合物番号	R ¹	A ¹	A ²	A ³	X ²	X ⁴
VI-112	(3-F-4-OMe)Ph	C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂	CH	CH
VI-113	(3-F-4-OMe)Ph	CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH	CH
VI-114	(3-F-4-OMe)Ph	CHCH ₃	CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH	CH
VI-115	(3-F-4-OMe)Ph	C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂	N	CH
VI-116	(3-F-4-OMe)Ph	CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH ₂	N	CH
VI-117	(3-F-4-OMe)Ph	CHCH ₃	CH ₂	C(CH ₃) ₂	N	CH
VI-118	(3-F-4-OMe)Ph	CHCH ₃	CH ₂	CHCH ₃	CH	CH
VI-119	(3-F-4-OMe)Ph	CHCH ₃	CHCH ₃	CH ₂	CH	CH
VI-120	(3-F-4-OMe)Ph	CHCH ₃	CH ₂	CHCH ₃	N	CH

[0194]

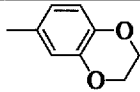
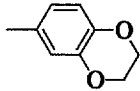
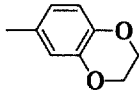
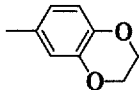
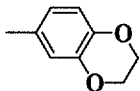
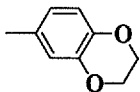
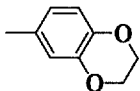
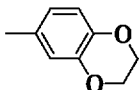
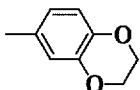
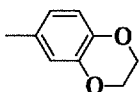
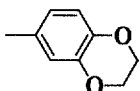
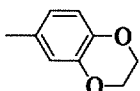
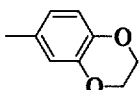
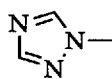
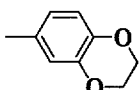
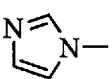
[表59]

					
化合物番号	R ¹	R ²	R ³	X ³	X ⁴
VII-1		H	NH ₂	CH	CH
VII-2		H	Cl	CH	CH
VII-3		H	OSO ₂ Me	CH	CH
VII-4		H	SCH ₃	CH	CH
VII-5		H	SOCH ₃	CH	CH
VII-6		H	SO ₂ CH ₃	CH	CH
VII-7		H	SCH ₂ CF ₃	CH	CH
VII-8		H	SOCH ₂ CF ₃	CH	CH
VII-9		H	SO ₂ CH ₂ CF ₃	CH	CH
VII-10		H	OCOCH ₃	CH	CH
VII-11		H	OPh	CH	CH

[表60]

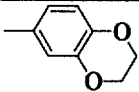
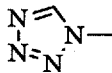
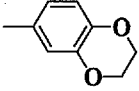
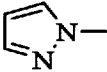
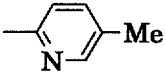
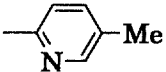
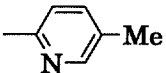
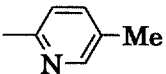
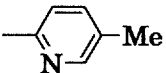
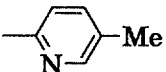
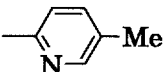
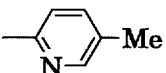
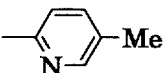
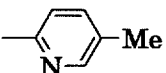
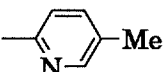
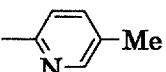
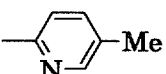
化合物番号	R ¹	R ²	R ³	X ³	X ⁴
VII-12		H	SPh	CH	CH
VII-13		H	SOPh	CH	CH
VII-14		H	SO ₂ Ph	CH	CH
VII-15		H	OSO ₂ Ph	CH	CH
VII-16		H	OCOPh	CH	CH
VII-17		H		CH	CH
VII-18		H		CH	CH
VII-19		H		CH	CH
VII-20		H		CH	CH
VII-21		H	NH ₂	CH	CH
VII-22		H	Cl	CH	CH
VII-23		H	OSO ₂ Me	CH	CH
VII-24		H	SCH ₃	CH	CH

[表61]

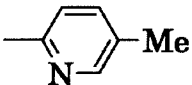
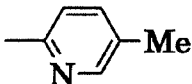
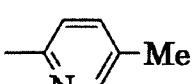
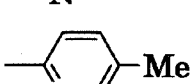
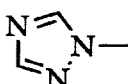
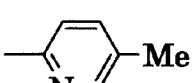
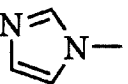
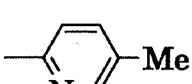
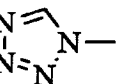
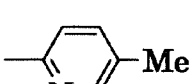
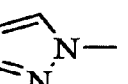
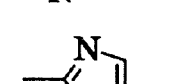
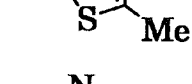
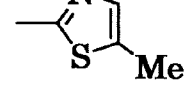
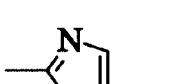
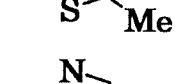
化合物番号	R ¹	R ²	R ³	X ³	X ⁴
VII-25		H	SOCH ₃	CH	CH
VII-26		H	SO ₂ CH ₃	CH	CH
VII-27		H	SCH ₂ CF ₃	CH	CH
VII-28		H	SOCH ₂ CF ₃	CH	CH
VII-29		H	SO ₂ CH ₂ CF ₃	CH	CH
VII-30		H	OCOCH ₃	CH	CH
VII-31		H	OPh	CH	CH
VII-32		H	SPh	CH	CH
VII-33		H	SOPh	CH	CH
VII-34		H	SO ₂ Ph	CH	CH
VII-35		H	OSO ₂ Ph	CH	CH
VII-36		H	OCOPh	CH	CH
VII-37		H		CH	CH
VII-38		H		CH	CH

[0197]

[表62]

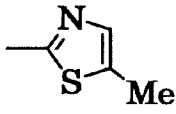
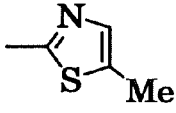
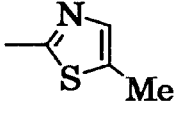
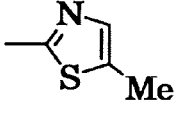
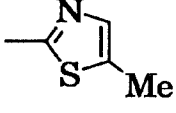
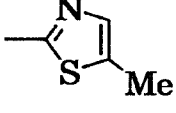
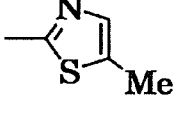
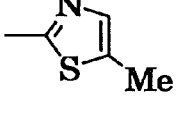
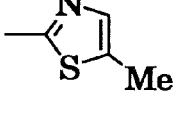
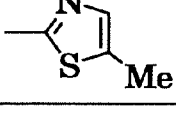
化合物番号	R ¹	R ²	R ³	X ³	X ⁴
VII-39		H		CH	CH
VII-40		H		CH	CH
VII-41		H	NH ₂	CH	CH
VII-42		H	Cl	CH	CH
VII-43		H	OSO ₂ Me	CH	CH
VII-44		H	SCH ₃	CH	CH
VII-45		H	SOCH ₃	CH	CH
VII-46		H	SO ₂ CH ₃	CH	CH
VII-47		H	SCH ₂ CF ₃	CH	CH
VII-48		H	SOCH ₂ CF ₃	CH	CH
VII-49		H	SO ₂ CH ₂ CF ₃	CH	CH
VII-50		H	OCOCH ₃	CH	CH
VII-51		H	OPh	CH	CH
VII-52		H	SPh	CH	CH
VII-53		H	SOPh	CH	CH

[表63]

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	X ³	X ⁴
VII-54		H	SO ₂ Ph	CH	CH
VII-55		H	OSO ₂ Ph	CH	CH
VII-56		H	OCOPh	CH	CH
VII-57		H		CH	CH
VII-58		H		CH	CH
VII-59		H		CH	CH
VII-60		H		CH	CH
VII-61		H	NH ₂	CH	CH
VII-62		H	Cl	CH	CH
VII-63		H	OSO ₂ Me	CH	CH
VII-64		H	SCH ₃	CH	CH
VII-65		H	SOCH ₃	CH	CH

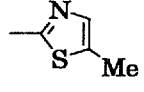
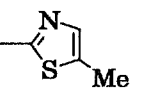
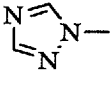
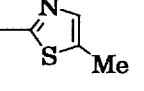
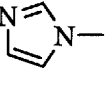
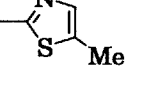
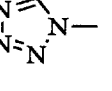
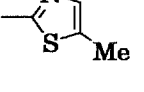
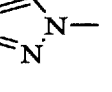
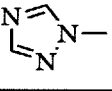
[0199]

[表64]

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	X ³	X ⁴
VII-66		H	SO ₂ CH ₃	CH	CH
VII-67		H	SCH ₂ CF ₃	CH	CH
VII-68		H	SOCH ₂ CF ₃	CH	CH
VII-69		H	SO ₂ CH ₂ CF ₃	CH	CH
VII-70		H	OCOCH ₃	CH	CH
VII-71		H	OPh	CH	CH
VII-72		H	SPh	CH	CH
VII-73		H	SOPh	CH	CH
VII-74		H	SO ₂ Ph	CH	CH
VII-75		H	OSO ₂ Ph	CH	CH

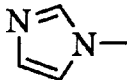
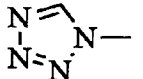
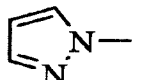
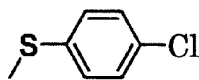
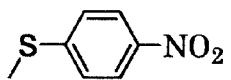
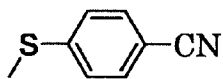
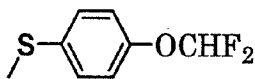
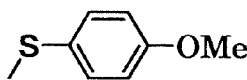
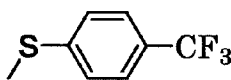
[0200]

[表65]

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	X ³	X ⁴
VII-76		H	OCOPh	CH	CH
VII-77		H		CH	CH
VII-78		H		CH	CH
VII-79		H		CH	CH
VII-80		H		CH	CH
VII-81	(4-OMe)Ph	H	NH ₂	CH	CH
VII-82	(4-OMe)Ph	H	Cl	CH	CH
VII-83	(4-OMe)Ph	H	OSO ₂ Me	CH	CH
VII-84	(4-OMe)Ph	H	SCH ₃	CH	CH
VII-85	(4-OMe)Ph	H	SOCH ₃	CH	CH
VII-86	(4-OMe)Ph	H	SO ₂ CH ₃	CH	CH
VII-87	(4-OMe)Ph	H	SCH ₂ CF ₃	CH	CH
VII-88	(4-OMe)Ph	H	SOCH ₂ CF ₃	CH	CH
VII-89	(4-OMe)Ph	H	SO ₂ CH ₂ CF ₃	CH	CH
VII-90	(4-OMe)Ph	H	OCOCH ₃	CH	CH
VII-91	(4-Me)Ph	H	OPh	CH	CH
VII-92	(4-Me)Ph	H	SPh	CH	CH
VII-93	(4-Me)Ph	H	SOPh	CH	CH
VII-94	(4-Me)Ph	H	SO ₂ Ph	CH	CH
VII-95	(4-Me)Ph	H	OSO ₂ Ph	CH	CH
VII-96	(4-Me)Ph	H	OCOPh	CH	CH
VII-97	(4-Me)Ph	H		CH	CH

[0201]

[表66]

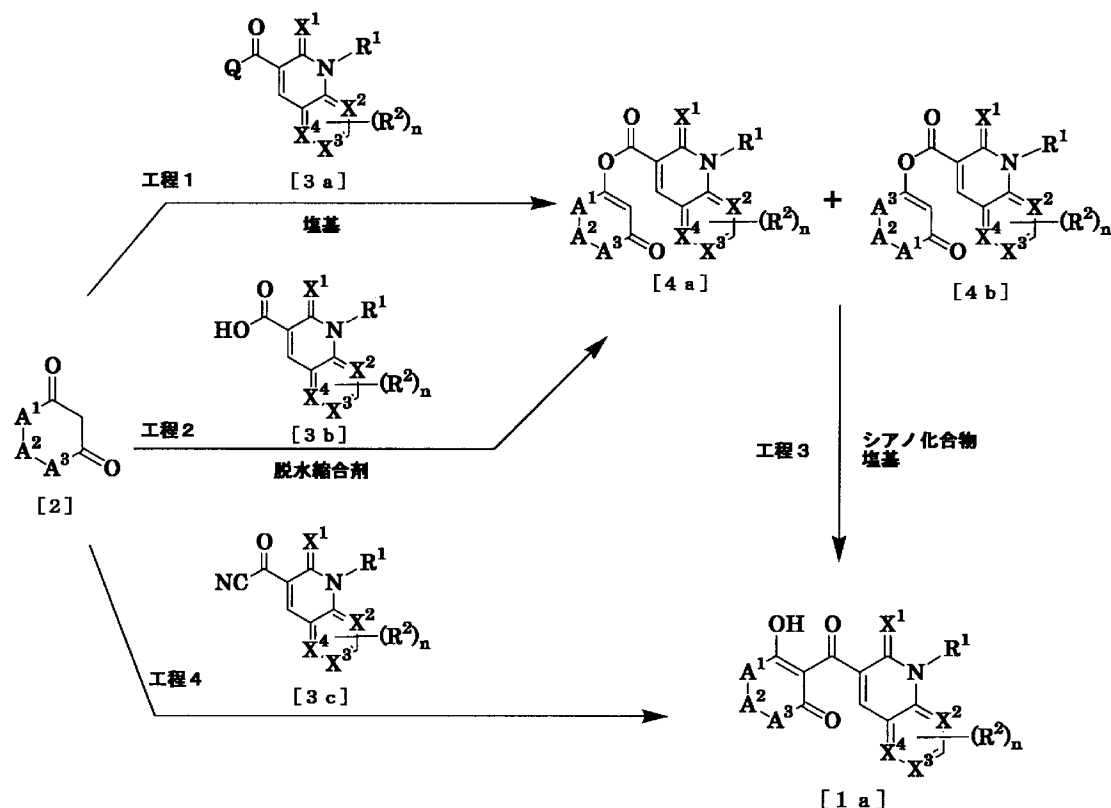
化合物番号	R ¹	R ²	R ³	X ³	X ⁴
VII-98	(4-Me)Ph	H		CH	CH
VII-99	(4-Me)Ph	H		CH	CH
VII-100	(4-Me)Ph	H		CH	CH
VII-101	(3-F-4-Me)Ph	H	SCH ₂ CH=CH ₂	CH	CH
VII-102	(3-F-4-Me)Ph	H	SOCH ₂ CH=CH ₂	CH	CH
VII-103	(3-F-4-Me)Ph	H	SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH	CH
VII-104	(3-F-4-Me)Ph	H	SCH ₂ CH≡CH	CH	CH
VII-105	(3-F-4-Me)Ph	H	SOCH ₂ CH≡CH	CH	CH
VII-106	(3-F-4-Me)Ph	H	SO ₂ CH ₂ CH≡CH	CH	CH
VII-107	(3-F-4-Me)Ph	H	OCOCH=CH ₂	CH	CH
VII-108	(3-F-4-Me)Ph	H		CH	CH
VII-109	(3-F-4-Me)Ph	H		CH	CH
VII-110	(3-F-4-Me)Ph	H		CH	CH
VII-111	(3-F-4-OMe)Ph	H		CH	CH
VII-112	(3-F-4-OMe)Ph	H		CH	CH
VII-113	(3-F-4-OMe)Ph	H		CH	CH

[0202] 式 [I] で示される本発明の化合物の代表的な製造方法を以下に例示するが、これらの方法に限定されるものではない。

[0203] <製造方法 1>

次の一般式 [1 a] で示される本発明化合物は下記に例示する反応式からなる方法により製造することができる。

[0204] [化8]



[0205] (式中、 R^1 、 R^2 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 n 、 X^1 、 X^2 、 X^3 及び X^4 はそれぞれ前記と同じ意味を表し、 Q は、ハロゲン、アルキルカルボニルオキシ基、アルコキシカルボニルオキシ基、ハロアルキルカルボニルオキシ基、ハロアルコキシカルボニルオキシ基、ベンゾイルオキシ基、ピリジル基、イミダゾリル基等の脱離基を表す。)

(工程 1)

一般式 [2] で表される化合物と式 [3 a] で表される化合物とを、溶媒中、塩基の存在下で反応させることにより、一般式 [4 a] 及び [4 b] で表されるエノールエステル化合物を製造することができる。

(以下、例えば「一般式 [2] で表される化合物」のことを、単に「式 [2] 」と略記することがある。)

ここで使用する式〔3 a〕の使用量は、式〔2〕 1モルに対して0.5～10モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.0～1.2モルである。

[0206] 本工程で使用できる塩基としては、例えばトリエチルアミン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、N,N-ジメチルアニリン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕-7-ウンデセン等の有機アミン類；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸マグネシウム、炭酸カルシウム等の金属炭酸塩類；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の金属炭酸水素塩類；酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウム、酢酸マグネシウム等の金属酢酸塩類に代表されるカルボン酸金属塩類；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、ナトリウムターシャリーブトキシド、カリウムメトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等の金属アルコキシド；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウム等の金属水酸化物；水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化カルシウム等の金属水素化物等があげられる。

[0207] 塩基の使用量は、式〔2〕 1モルに対して0.5～10モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.0～1.2モルである。

[0208] 本工程で使用できる溶媒としては、本反応の進行を阻害しないものであればよく、例えば、アセトニトリル等のニトリル類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグリム、ジグリム等のエーテル類；ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素、テトラクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、クロロベンゼン、ニトロベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等のアミド類；1,3-ジメチル-2-イミダゾリノン等のイミダゾリノン類；ジメチルスルホキシド等の硫黄化合物類等を使用することができ、さらにこれらの混合溶媒も使用することができる。

[0209] 溶媒の使用量は、式〔2〕 1モルに対して0.01～100Lであり、好

ましくは0.1～10Lである。

[0210] 反応温度は -20°C から使用する不活性溶媒の沸点域の範囲から選択すればよく、好ましくは 0°C ～ 100°C の範囲で行なうのがよい。

[0211] また、四級アンモニウム塩等の相間移動触媒を用いて、反応させることもできる。相間移動触媒を使用する場合その使用量は、式〔2〕1モルに対して0.0001～1.0モルであり、好ましくは0.001～0.1モルである。

[0212] 反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常10分～48時間である。

[0213] 反応の目的物である式〔4a〕及び式〔4b〕の化合物は、反応終了後、常法により反応系から採取され、必要に応じてカラムクロマトグラフィー、再結晶等の操作によって精製することもできる。

[0214] (工程2)

式〔4a〕及び〔4b〕は、式〔2〕と式〔3b〕とを、塩基の存在下又は非存在下、脱水縮合剤存在下、溶媒中で反応させることによっても製造することができる。

[0215] 本工程で使用する式〔3b〕の使用量は、式〔2〕1モルに対して0.5～10モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.0～1.2モルである。

[0216] 脱水縮合剤としては、ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)、N-(3-ジメチルアミノプロピル)-N'-エチルカルボジイミド(EDC又はWSC)、N,N-カルボニルジイミダゾール、2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリウムクロリド、ヨウ化-2-クロロ-1-ピリジニウム等を用いることができる。

[0217] 本工程で使用する塩基及び溶媒としては、工程1で説明した同様のものをあげることができる。

[0218] 本工程で使用する塩基の量は、式〔2〕1モルに対して、0～100モルであり、好ましくは0～10モルである。

- [0219] また、溶媒の使用量は、式 [2] 1 モルに対して 0.01 ~ 100 L であり、好ましくは 0.1 ~ 10 L である。
- [0220] 反応温度は -20 °C から使用する不活性溶媒の沸点域の範囲から選択すればよく、好ましくは 0 °C ~ 100 °C の範囲で行なうのがよい。
- [0221] 反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常 10 分 ~ 48 時間である。
- [0222] (工程 3)
- 式 [1 a] は、前記工程 1 又は 2 で製造された式 [4 a] 及び式 [4 b] とシアノ化合物とを塩基の存在下で反応させることによって製造することができる。
- [0223] 本工程で使用できる塩基としては、工程 1 で説明した塩基と同様のものをあげることができる。
- [0224] 塩基の使用量は、式 [4 a] 及び式 [4 b] 1 モルに対して 0.5 ~ 10 モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは 1.0 ~ 1.2 モルである。
- [0225] 本工程で使用できるシアノ化合物としては、シアン化カリウム、シアン化ナトリウム、アセトンシアンヒドリン、シアン化水素、シアン化水素を保持したポリマー等をあげることができる。
- [0226] シアノ化合物の使用量は、式 [4 a] 及び [4 b] 1 モルに対して 0.01 ~ 1.0 モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは 0.05 ~ 0.2 モルである。
- [0227] また、本工程では、クラウンエーテル等の相間移動触媒を用いてもよい。
- [0228] 相間移動触媒の使用量は、式 [4 a] 及び [4 b] に対して 0.001 ~ 10 モルであり、好ましくは 0.01 ~ 1.0 モルである。
- [0229] 本工程で使用できる溶媒としては、工程 1 で説明した溶媒と同様のものをあげることができ、使用量は、式 [4 a] 及び [4 b] 1 モルに対して 0.01 ~ 100 L であり、好ましくは 0.1 ~ 10 L である。
- [0230] 反応温度は -20 °C から使用する不活性溶媒の沸点域の範囲から選択すれ

ばよく、好ましくは 0°C ～ 100°C の範囲で行なうのがよい。

[0231] 反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常10分～48時間である。

[0232] なお、本工程において、工程1又は工程2で製造される式[4a]及び[4b]を単離することなく用いても、式[1a]を製造することができる。

[0233] (工程4)

式[1a]の化合物は、式[2]と式[3c]とを、溶媒中、塩基又はルイス酸存在下で反応させることによっても製造することができる。

[0234] 本工程で使用する式[3c]の使用量は、式[2]1モルに対して0.5～10モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.0～1.2モルである。

[0235] 使用できるルイス酸としては、例えば塩化亜鉛、塩化アルミニウム等があげられる。

[0236] ルイス酸を使用する場合、ルイス酸の使用量は、式[2]1モルに対して0.01～100モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは0.1～10モルである。

[0237] 本工程で使用できる塩基としては、工程1で説明した塩基と同様のものをあげることができる。

[0238] 塩基を使用する場合、塩基の使用量は、式[2]1モルに対して0.5～10モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.0～1.2モルである。

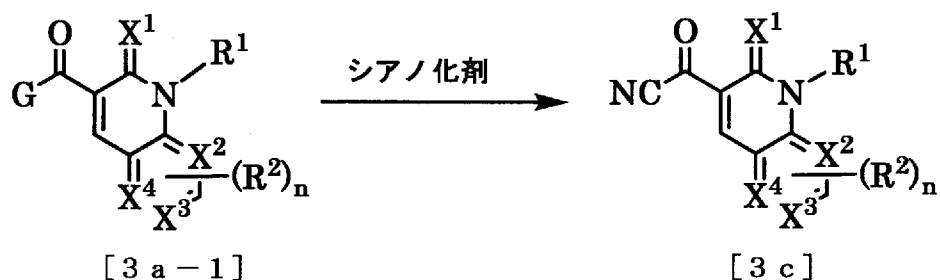
[0239] 本工程で使用できる溶媒としては、工程1で説明した溶媒と同様のものをあげることができ、使用量は、式[2]1モルに対して0.01～100Lであり、好ましくは0.1～10Lである。

[0240] 反応温度は -20°C から使用する不活性溶媒の沸点域の範囲から選択すればよく、好ましくは 0°C ～ 100°C の範囲で行なうのがよい。

[0241] 反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常10分～48時間である。

[0242] ここで、式 [3 c] の製造中間体は、式 [3 a-1] で表される化合物とシアノ化剤とを反応させることにより製造することができる。

[0243] [化9]



[0244] (式中、 R^1 、 R^2 、 n 、 X^1 、 X^2 、 X^3 及び X^4 はそれぞれ前記と同じ意味を表し、 G は塩素、臭素などのハロゲン原子を表す。)

シアノ化剤としては、アルカリ金属シアン化物、アルカリ土類金属シアン化物が用いられる。

シアノ化剤の使用量は化合物 [3 a-1] 1モルに対して0.5～10モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは0.9～1.1モルである。

[0245] 反応温度は -20°C から使用する不活性溶媒の沸点域の範囲から選択すればよく、好ましくは 0°C ～ 100°C の範囲で行なうのがよい。

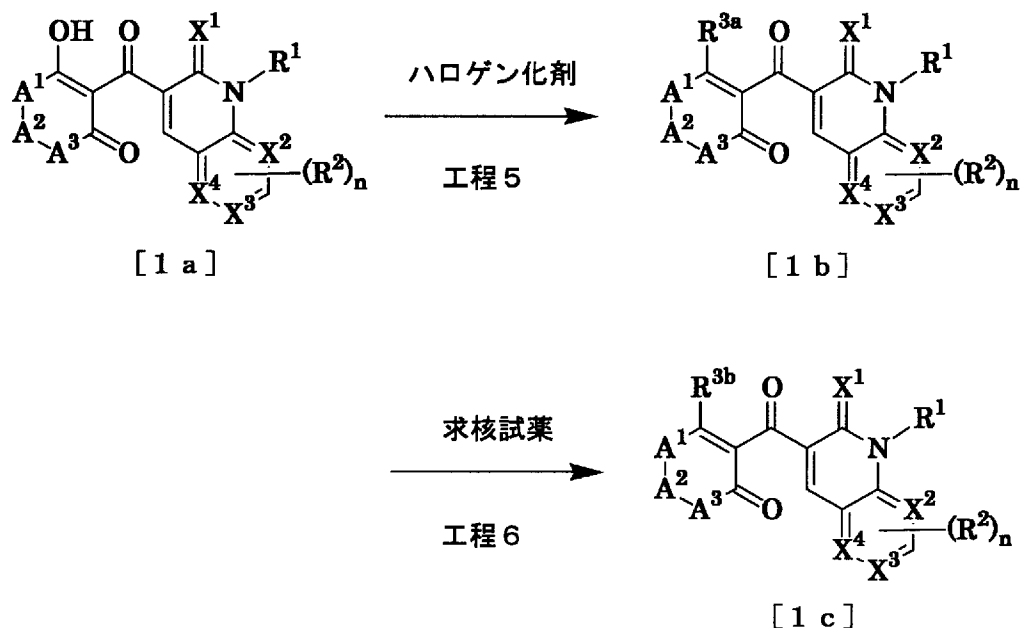
[0246] 反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常10分～48時間である。

[0247] <製造方法2>

さらに、前記した本発明の式 [1 a] で表される化合物から、以下の製造方法によって本発明の式 [1 b] 及び [1 c] で表される化合物を製造することができる。

[0248]

[化10]



[0249] (式中、 R^{3a} は塩素、臭素などのハロゲン原子を表し、 R^{3b} は $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルチオ基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルチオ基、フェノキシ基（該基は、1個又は2～5個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。）、フェニルチオ基（該基は、1個又は2～5個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。）、アミノ基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルカルボニルオキシ基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルカルボニルオキシ基、フェニルカルボニルオキシ基（該基は、1個又は2～5個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。）、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基、1, 2, 3-トリアゾール-1-イル基、1, 2, 3-トリアゾール-2-イル基、イミダゾール-1-イル基、ピラゾール-1-イル基、テトラゾール-1-イル基、又はテトラゾール-2-イル基を表し、 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 R^1 、 R^2 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 n 及び R^{10} はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

すなわち、式[1a]の化合物とハロゲン化剤とを、溶媒中で反応させることにより、式[1b]の化合物を製造し、さらに式[1b]の化合物と求

核試薬とを、溶媒中、塩基の存在下で反応させることにより式 [1 c] の化合物を製造することができる。

[0250] 工程 5 で使用できるハロゲン化剤としては、塩化チオニル、臭化チオニル、オキシ塩化リン、オキシ臭化リン、フェニルトリメチルアンモニウムトリブロミド、メルドラム酸トリブロミド等があげられる。

[0251] ハロゲン化剤の使用量は、式 [1 a] の化合物 1 モルに対して 0.5 ~ 1.0 モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは 1.0 ~ 1.2 モルである。

[0252] ここで使用できる溶媒としては、製造方法 1 の工程 1 で説明した溶媒と同様のものをあげることができ、使用量は、式 [1 a] 1 モルに対して 0.01 ~ 100 L であり、好ましくは 0.1 ~ 10 L である。

[0253] 反応温度は -20 °C から使用する不活性溶媒の沸点域の範囲から選択すればよく、好ましくは 0 °C ~ 100 °C の範囲で行なうのがよい。

[0254] 反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常 10 分 ~ 48 時間である。

[0255] 工程 6 で、使用できる求核試薬としては、メタノール又はエタノール等の C₁ ~ C₆ アルキルアルコール類；メチルメルカプタン又はエチルメルカプタン等の C₁ ~ C₆ アルキルメルカプタン類；アリルメルカプタン等の C₂ ~ C₆ アルケニルメルカプタン類；2-ペンチン-1-メルカプタン等の C₂ ~ C₆ アルキニルメルカプタン類；p-クレゾール又はフェノール等のフェノール類；p-クロロチフェノール等のチオフェノール類；2,2,2-トリフルオロエチルメルカプタン等の C₁ ~ C₆ ハロアルキルメルカプタン類；酢酸等の C₁ ~ C₆ アルキル酸類；アクリル酸等の C₁ ~ C₆ アルケニル酸類；プロピオン酸等の C₁ ~ C₆ アルキニル酸類；安息香酸類；1H-1,2,3-トリアゾール類；1H-1,2,4-トリアゾール類；1H-イミダゾール類；1H-ピラゾール類；1H-テトラゾール類；アンモニア等をあげることができる。

[0256] R^{3b} は C₁ ~ C₆ アルコキシ基、C₁ ~ C₆ アルキルチオ基、C₂ ~ C₆ アルケ

ニルチオ基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルチオ基、フェノキシ基（該基は、1個又は2～5個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。）、フェニルチオ基（該基は、1個又は2～5個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。）、アミノ基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルカルボニルオキシ基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルカルボニルオキシ基、フェニルカルボニルオキシ基（該基は、1個又は2～5個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。）、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基、1, 2, 3-トリアゾール-1-イル基、1, 2, 3-トリアゾール-2-イル基、イミダゾール-1-イル基、ピラゾール-1-イル基、テトラゾール-1-イル基、又はテトラゾール-2-イル基を表す。

[0257] 求核試薬の使用量は、式[1b]の化合物1モルに対して0.5～10モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.0～1.2モルである。

[0258] 使用できる塩基としては、製造方法1の工程1で説明した塩基と同様のものをあげることができ、使用量は、式[1a]1モルに対して0.5～10モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.0～1.2モルである。

[0259] 使用できる溶媒としては製造方法1の工程1で説明した溶媒と同様のものをあげることができ、使用量は、式[1a]に対して0.01～100Lであり、好ましくは0.1～10Lである。

[0260] 反応温度は -20°C から使用する不活性溶媒の沸点域の範囲から選択すればよく、好ましくは $0^{\circ}\text{C} \sim 100^{\circ}\text{C}$ の範囲で行なうのがよい。反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常10分～48時間である。

[0261] <製造方法3>

また、次の一般式[1d]で示される本発明化合物は下記に例示する反応式からなる方法により製造することができる。

[0262]

[化11]



[0263] (式中、 R^{3c} は $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、ベンジルオキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルカルボニルオキシ基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルカルボニルオキシ基、フェニルスルホニルオキシ基（該基は、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。）、又はフェニルカルボニルオキシ基（該基は、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。）を表し、 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 R^1 、 R^2 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 n 及び R^{10} はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

[0264] すなわち、式[1a]の化合物と求電子試薬とを、溶媒中、塩基の存在下又は非存在下で反応させることにより、式[1d]の化合物を製造することができる。

[0265] 使用できる求電子試薬としては、例えばヨウ化メチル又は塩化プロピル等の $C_1 \sim C_6$ アルキルハロゲン化物；臭化ベンジル等のハロゲン化ベンジル；塩化アセチル又は塩化プロピオニル等の $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルハロゲン化物；塩化ベンゾイル等のハロゲン化ベンゾイル；塩化メタクリル又は塩化クロトニル等の $C_2 \sim C_6$ アルケニルカルボニルハロゲン化物；塩化4-ペンチオノイル等の $C_2 \sim C_6$ アルキニルカルボニルハロゲン化物；塩化メタンスルホニル又は塩化エタンスルホニル等の $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホン酸ハロゲン化物；塩化ベンゼンスルホニル又は塩化p-トルエンスルホニル等のベンゼンスルホン酸ハロゲン化物；ジメチル硫酸、ジエチル硫酸等のジ $C_1 \sim C_6$ アルキル硫酸エステル等があげられる。

[0266] 求電子試薬の使用量は、式[1a]の化合物1モルに対して0.1～10

モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.0～1.2モルである。

[0267] 使用できる塩基としては、製造方法1の工程1で説明した塩基と同様のものをあげることができ、塩基の使用量は、式[1a]の化合物1モルに対して0～10モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは1.0～1.2モルである。

[0268] 使用できる溶媒としては製造方法1の工程1で説明した溶媒と同様のものをあげることができ、使用量は、式[1a]1モルに対して0.01～100Lであり、好ましくは0.1～10Lである。

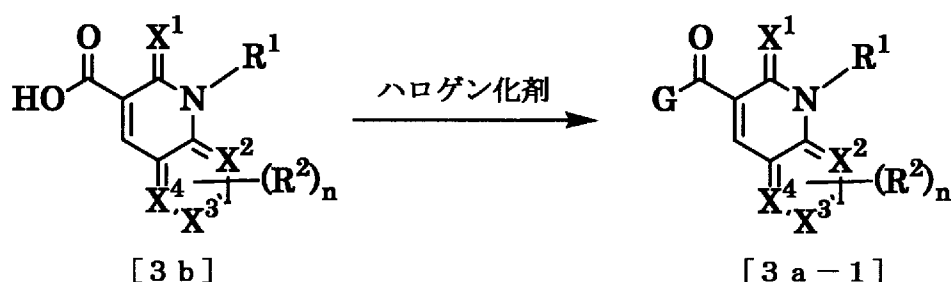
[0269] 反応温度は－20℃から使用する不活性溶媒の沸点域の範囲から選択すればよく、好ましくは0℃～100℃の範囲で行なうのがよい。

[0270] 反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常10分～48時間である。

[0271] 次に本発明化合物の製造中間体の製造法を示す。

[0272] 〈中間体製造法1〉

[0273] [化12]



[0274] (式中、 R^1 、 R^2 、 n 、 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 及びGはそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

本発明化合物の製造中間体である式[3a-1]は、式[3b]とハロゲン化剤とを溶媒中又は無溶媒中で反応させることによって製造することができる。)

本反応で使用できるハロゲン化剤としては、例えば塩化オキザリル、塩化チオニル等があげられる。

[0275] ハロゲン化剤の使用量は、式 [3 b] 1 モルに対して 0.01 ~ 100 モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは 0.1 ~ 10 モルである。

[0276] 溶媒としては例えばジクロロメタン又はクロロホルム等のハロゲン炭化水素類、ジエチルエーテル又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、ベンゼン又はトルエン等の芳香族炭化水素類があげられる。

[0277] 溶媒の使用量は、式 [3 b] 1 モルに対して 0 ~ 100 L であり、好ましくは 0.01 ~ 10 L である。

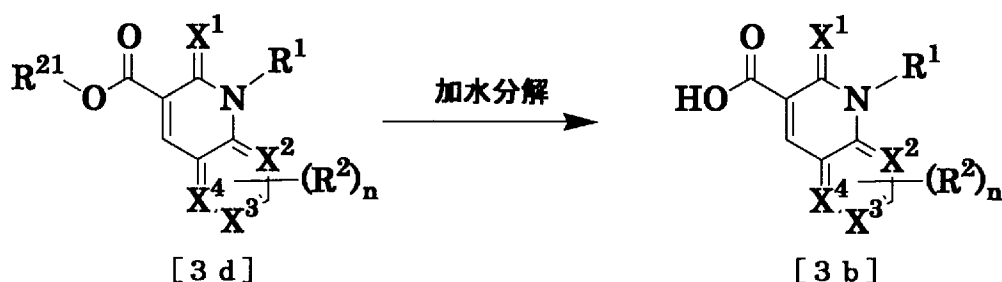
[0278] 反応温度は、-100℃ ~ 200℃ の範囲から選択すればよく、好ましくは 0℃ ~ 100℃ で行うのがよい。

[0279] 反応時間は、反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常 10 分 ~ 24 時間である。

[0280] また、本反応では触媒量の DMF (N, N-ジメチルホルムアミド) 等のアミド類を添加してもよい。

[0281] 〈中間体製造法 2〉

[0282] [化13]

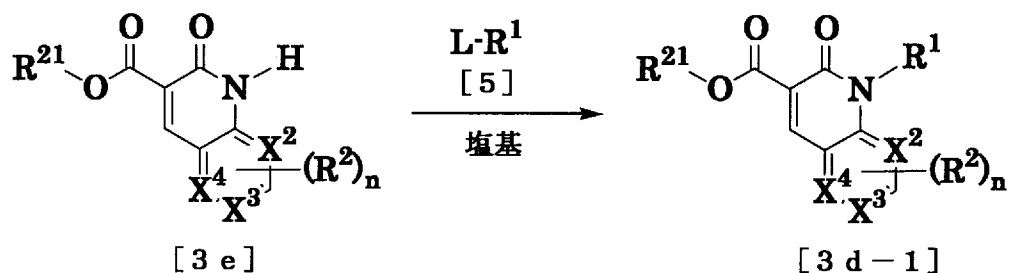


[0283] (式中、R¹、R²、n、X¹、X²、X³及びX⁴はそれぞれ前記と同じ意味を表し、R²¹は低級アルキル基、置換されてもよいベンジル基又は置換されてもよいフェニル基を表す。)

式 [3 b] の製造中間体は、式 [3 d] を溶媒中、酸存在下又は塩基存在下で加水分解させることにより製造することができる。

[0284] 本反応で利用できる塩基としては、例えば水酸化リチウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウム又は水酸化ナトリウム等の無機塩基、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] -7-ウンデセン等の有機塩基があげられる。

- [0285] 塩基の使用量は、化合物 [3 d] 1 モルに対して 0.01 ~ 100 モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは 0.1 ~ 10 モルである。
- [0286] 本反応で使用する酸としては、例えば塩酸、臭化水素酸、硫酸などの無機酸、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸があげられる。
- [0287] 酸の使用量は、化合物 [3 d] 1 モルに対して 1 モル ~ 大過剰使用することができ、好ましくは 1 ~ 100 モルである。
- [0288] 本反応で使用する溶媒としては、水又は水と有機溶媒との混合溶媒である。
- [0289] 有機溶媒としては例えばメタノール又はエタノール等のアルコール類、テトラヒドロフラン等のエーテル類、アセトン又はメチルイソブチルケトン等のケトン類、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、アセトニトリル或いはそれらの混合物があげられる。
- [0290] 溶媒の使用量は、式 [3 d] 1 モルに対して 0.01 ~ 100 L であり、好ましくは 0.1 ~ 10 L である。
- [0291] 反応温度は -100 ~ 200 °C の範囲から選択すればよく、好ましくは 0 °C ~ 100 °C で行うのがよい。
- [0292] 反応時間は反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常 10 分 ~ 24 時間である。
- [0293] 〈中間体製造法 3〉
- [0294] [化14]



- [0295] (式中、L はハロゲン原子、C₁ ~ C₄ アルキルスルホニルオキシ基、C₁ ~ C₄ アルキルスルホニル基、置換されてもよいベンジルスルホニル基、置換され

ていてもよいフェニルスルホニル基又は置換されていてもよいフェニルスルホニルオキシ基又は置換されていてもよいベンジルスルホニルオキシ基等の脱離基を表し、 R^1 、 R^2 、 $R^{2'}$ 、 n 、 X^2 、 X^3 及び X^4 はそれぞれ前記と同じ意味を表す。但し、 R^1 がハロアルキル基の場合、 L はハロアルキル化して残ったハロゲン原子より反応性の高い脱離基を表す。例えば R^1 が CH_2F_2 基の場合、 L は塩素原子又は臭素原子を表し、 R^1 が CH_2CF_3 基の場合、 L は塩素原子、臭素原子、 p -トルエンスルホニルオキシ基、メチルスルホニルオキシ基、又はトリフルオロメタンスルホニルオキシ基等の脱離基を表す。
)

式〔3d-1〕の製造中間体は、式〔3e〕と式〔5〕とを、塩基存在下又は非存在下で、溶媒中又は無溶媒で反応させることにより製造することができる。

[0296] 本反応で使用する式〔5〕の使用量は、式〔3e〕1モルに対して0.01～100モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは0.1～10モルである。

[0297] 本反応で使用する塩基としては、例えば炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水素化カリウム又は水素化ナトリウム等アルカリ金属水素化物、ナトリウムエトキシド又はナトリウムメトキシド等のアルカリ金属アルコラート、或いは1,8-ジアザビシクロ〔5,4,0〕-7-ウンデセン等の有機塩基があげられる。

[0298] 本反応で使用する塩基の使用量は、式〔3e〕1モルに対して0～100モルの範囲から適宜選択すればよく、好ましくは0.1～10モルである。

[0299] 本反応で使用する溶媒としては、例えばジクロロメタン又はクロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、ベンゼン又はトルエン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン又はヘプタン等の脂肪族炭化水素類、アセトン又はメチルイソブチルケトン等の

ケトン類、酢酸エチル又は酢酸メチル等のエステル類、N-メチルピロリドン又はN, N-ジメチルホルムアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、アセトニトリル等のニトリル類、或いはそれらの混合物があげられる。

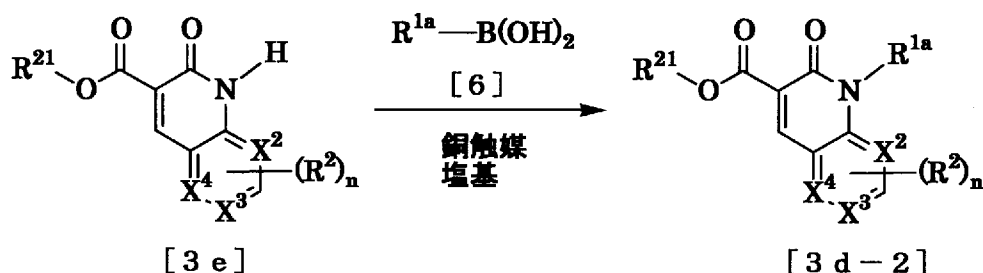
[0300] 本反応で使用する溶媒の使用量は、式 [3 e] 1 モルに対して 0 ~ 100 L の範囲から適宜選択すればよく、好ましくは 0 ~ 100 L である。

[0301] 本反応の反応温度は、-100℃から使用する不活性溶媒の沸点域の範囲から選択すればよく、好ましくは-20℃~100℃の範囲で行うのがよい。

[0302] 本反応の反応時間は、反応温度、反応基質、反応量等により異なるが、通常1時間から168時間である。

〈中間体製造法4〉

[0303] [化15]

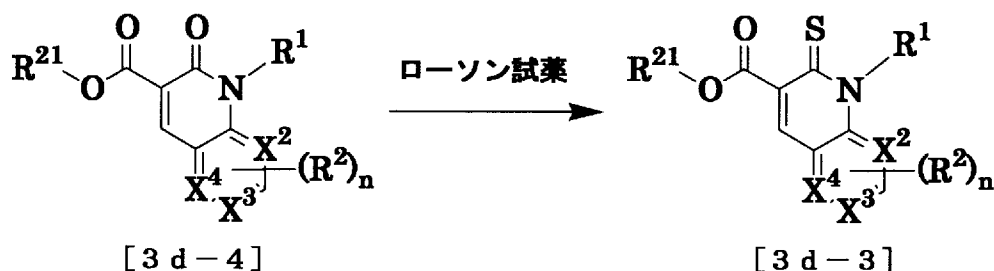


[0304] (式中、 R^{1a} は、 $\text{C}_6 \sim \text{C}_{10}$ アリール基(該基は、1又は2~5個の同一もしくは異なる R^4 により置換されてもよい。))又は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1~5個のヘテロ原子を有する炭素数2~10の複素環基(該基は、1又は2~5個の同一もしくは異なる R^5 により置換されてもよい。)を表し、 R^2 、 R^{21} 、 n 、 X^2 、 X^3 及び X^4 はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

式 [3 d-2] の製造中間体は、テトラヘドロン (Tetrahedron)、第55巻、第12757-12770頁 (1999年) に記載の方法に準じ、式 [3 e] と式 [6] とを銅触媒及び塩基存在下で反応させることにより製造することができる。

[0305] 〈中間体製造法 5〉

[0306] [化16]

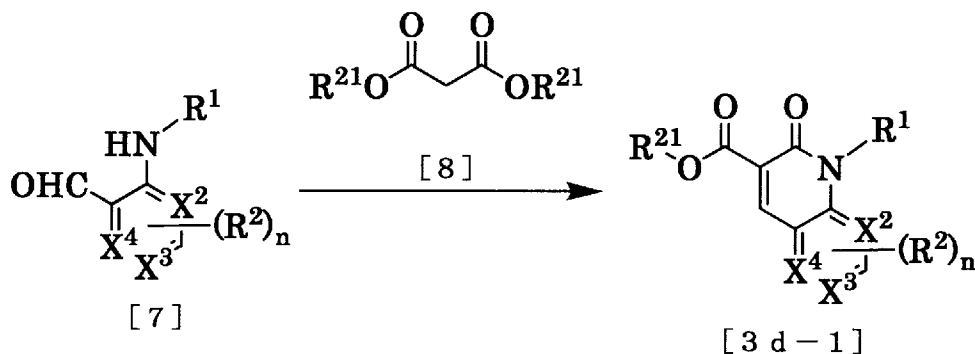


[0307] (式中、 R^1 、 R^2 、 R^{21} 、 n 、 X^2 、 X^3 及び X^4 はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

式 [3d-3] の製造中間体は、米国特許公開US2005/256000号公報に記載の方法に準じ、式 [3d-4] で表される化合物とローソン試薬 (Lawesson's Reagent) とを反応させることにより製造することができる。

[0308] 〈中間体製造法 6〉

[0309] [化17]



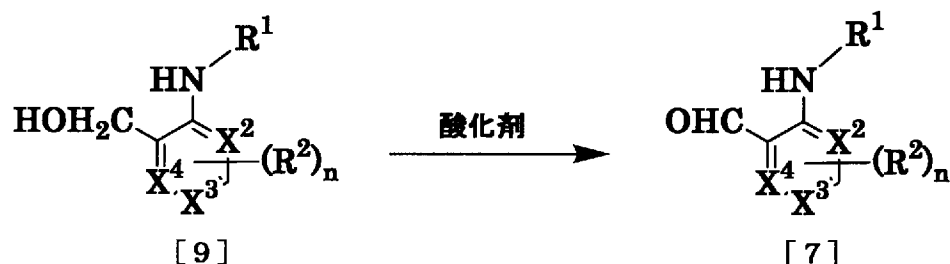
[0310] (式中、 R^1 、 R^2 、 R^{21} 、 n 、 X^2 、 X^3 及び X^4 はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

式 [3d-1] の製造中間体は、米国特許US6562811号公報、国際特許WO2007/53131号公報、ジャーナル・オブ・ザ・オーガニック・ケミストリー (Journal of the Organic Chemistry) 第58巻、第6625-6628頁 (1993年) の方法に準じ、式 [7] と式 [8] で表さ

れるマロン酸ジエステルとを反応させることにより製造することができる。

[0311] 〈中間体製造法 7〉

[0312] [化18]

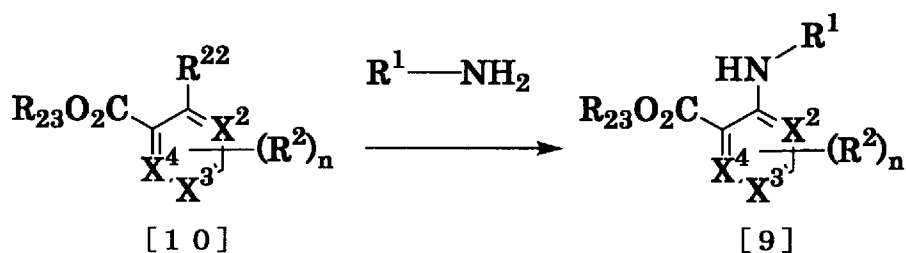


[0313] (式中、 R^1 、 R^2 、 n 、 X^2 、 X^3 及び X^4 はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

式 [7] は、実験化学講座第4版(丸善)、第23巻、21頁の「活性二酸化マンガンによる酸化の項」に準じて、式 [9] で表されるアルコール化合物を酸化することにより製造することができる。

〈中間体製造法 8〉

[0314] [化19]



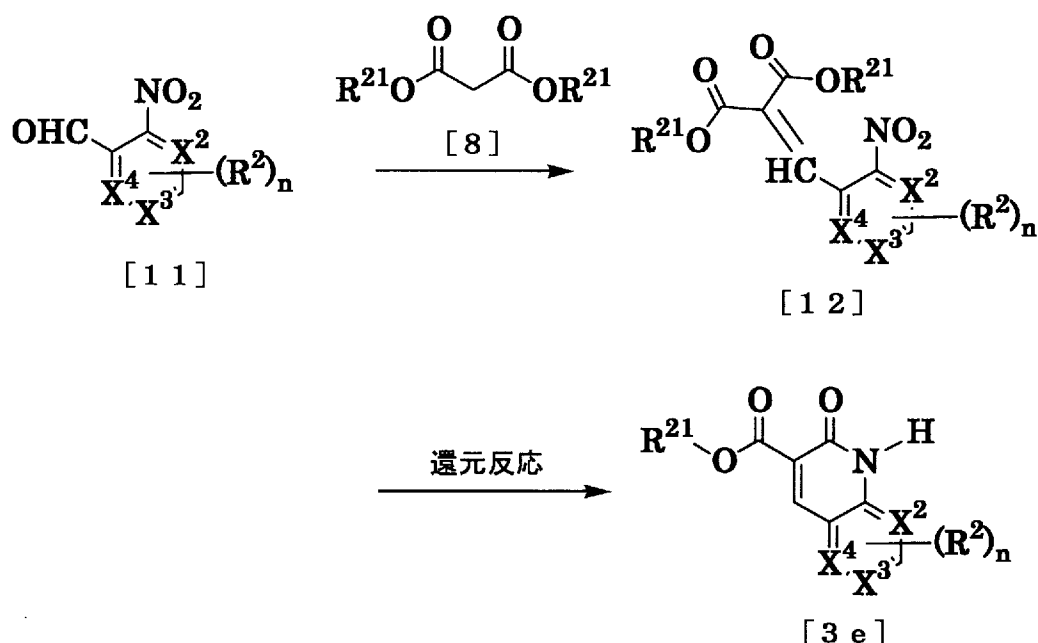
[0315] (式中、 R^1 、 R^2 、 n 、 X^2 、 X^3 及び X^4 はそれぞれ前記と同じ意味を表し、 R^{22} は、フッ素原子、塩素原子又は臭素原子等のハロゲン原子、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基、メタンスルホニルオキシ基、パラトルエンスルホニルオキシ基等の脱離基を表し、 R^{23} は、水素原子又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル基を表す。)

式 [9] の製造中間体は、WO2004/20414号公報、米国特許公開US2008/176827号公報、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー (Journal of Medicinal Chemistry)、第31巻、第2108

ー 2 1 2 1 頁（ 1 9 8 8 年） 及びジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー（Journal of Medicinal Chemistry）、第 4 8 巻、第 1 2 号、第 4 1 0 0－4 1 1 0 頁（ 2 0 0 5 年） 等に記載の方法に準じ、式 [1 0] と R^1-NH_2 とを反応させることにより製造することができる。

[0316] 〈中間体製造法 9〉

[0317] [化20]



[0318] (式中、 R^2 、 R^{21} 、 n 、 X^2 、 X^3 及び X^4 はそれぞれ前記と同じ意味を表す。)

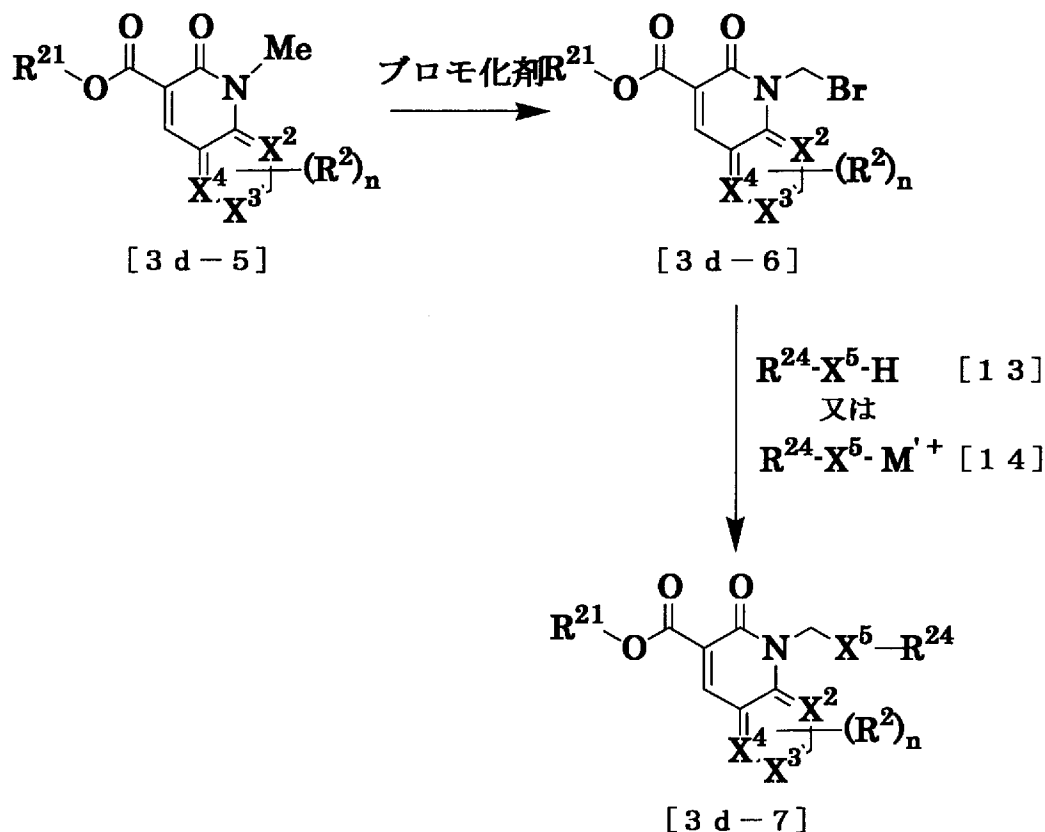
式 [3 e] の製造中間体は、上記に示す工程で製造することができる。

[0319] すなわち、式 [3 e] は、米国特許 US 5 5 7 1 8 2 0 号公報、米国特許 US 5 7 3 3 9 1 7 号公報、及びケミカル・アンド・ファーマシューティカル・ビューレティン（Chemical and Pharmaceutical Bulletin）、第 4 8 巻、第 1 2 号、2 0 0 3－2 0 0 8 頁（ 2 0 0 0 年） 等に記載の方法に準じ、式 [1 1] と式 [8] を反応させることにより得られた式 [1 2] を還元反応させることにより製造することができる。

[0320] 〈中間体製造法 1 0〉

[0321]

[化21]



[0322] (式中、 R^2 、 R^{21} 、 n 、 X^2 、 X^3 及び X^4 はそれぞれ前記と同じ意味を表し、 R^{24} は、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルオキシ基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基；フェノキシ基； $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基；シアノ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基；同一若しくは相異なってよい酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基又は $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基を表し、 M'^+ は、アルカリ金属カチオンを表し、 X^5 は酸素原子又は硫黄原子を表す。)

式[3d-7]の製造中間体は、上記に示す工程で製造することができる。

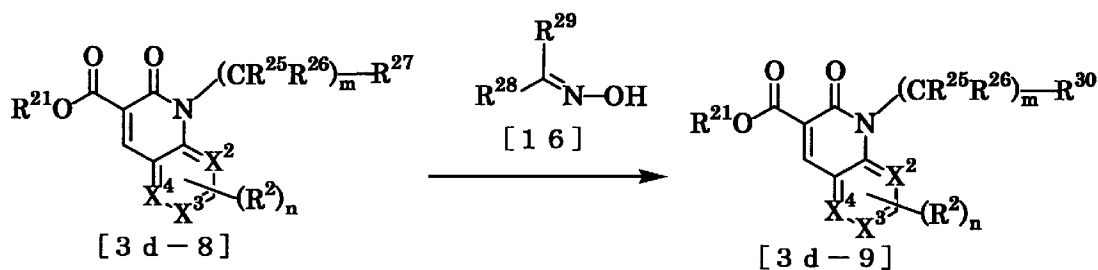
[0323] すなわち、式[3d-6]は、欧州特許公開EP1982978号公報等に記載の方法に準じ、式[3d-5]とN-ブロモスクシンイミドとを反応

させることにより製造することができる。

[0324] 式 [3 d-7] は、米国特許 US 5 1 5 5 2 7 2 号公報、欧州特許公開 EP-1 2 2 8 0 6 7 号公報、米国特許 US 4 0 5 8 3 9 2 号公報、及びジャーナル・オブ・ザ・ケミカル・ソサエティー・パーキン・トランザクションズ・1 (Journal of the Chemical Society Perkin Transactions 1) 第 7 8 1-7 9 0 頁 (1 9 8 7 年) 等に記載の方法に準じ、式 [3 d-6] と式 [1 3] 又は式 [1 4] で表される化合物とを反応させることにより製造することができる。

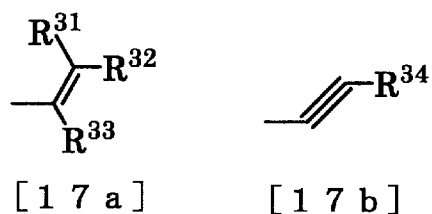
[0325] 〈中間体製造法 1 1〉

[0326] [化22]



[0327] (式中、 R^2 、 R^{21} 、 X^2 、 X^3 、 X^4 及び n はそれぞれ前記と同じ意味を表し、 R^{27} は次の式 [1 7 a] 又は式 [1 7 b] で表される基を表し、

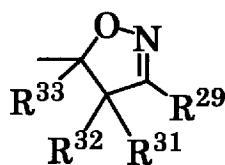
[0328] [化23]



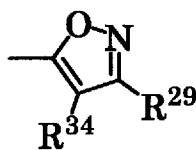
[0329] R^{30} は次の式 [1 8 a] 又は [1 8 b] で表される基を表し、

[0330]

[化24]



[18a]



[18b]

[0331] R^{25} 、 R^{26} 、 R^{31} 、 R^{32} 、 R^{33} 及び R^{34} は、それぞれ独立して水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルケニル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキニル基、 $C_1 \sim C_4$ シクロアルキル基又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基を表し、 R^{29} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルケニル基、 $C_1 \sim C_4$ アルキニル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_4$ シクロアルキル基、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基又は $C_1 \sim C_4$ ハロアルケニル基を表し、 R^{28} はハロゲン原子を表し、 m は、0～6の整数を表す。但し、 R^{27} が式[17a]のとき、 R^{30} は式[18a]であり、 R^{27} が式[17b]のとき、 R^{30} は式[18b]である。）

式[3d-9]の製造中間体は、WO2005/26123号公報、テトラヘドロン（Tetrahedron）、第40巻、第2985項（1984年）及びシンセシス・コミュニケーションズ（Synthetic Communications）、第18巻、第1171項（1988年）等に記載の方法に準じて、式[3d-8]と式[16]とを反応させることにより製造することができる。

[0332] 本発明の除草剤及び農薬組成物は、本発明の一般式[I]で表される2-ピリドン誘導体又はその農薬上許容される塩を活性成分として含有することを特徴とする。また、本発明は、本発明の一般式[I]で表される2-ピリドン誘導体又はその農薬上許容される塩の1種又は2種以上、及び農薬製剤に許容される担体とを含有してなる農薬組成物、より詳細には除草剤組成物に関する。

[0333] 本発明の除草剤には、必要に応じ農薬製剤に通常用いられる添加成分（担体）を含有することができる。

[0334] この添加成分としては、固体担体又は液体担体等の担体、界面活性剤、結

合剤や粘着付与剤、増粘剤、着色剤、拡張剤、展着剤、凍結防止剤、固結防止剤、崩壊剤、分解防止剤等があげられ、その他必要に応じ、防腐剤や、植物片等を添加成分に用いてもよい。

[0335] これらの添加成分は1種用いてもよいし、又、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

[0336] 上記添加成分について説明する。

[0337] 固体担体としては、例えば石英、クレー、カオリナイト、ピロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライト、珪藻土等の天然鉱物質類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウム、塩化カリウム等の無機塩類、合成ケイ酸、合成ケイ酸塩、デンプン、セルロース、植物粉末等の有機固体担体、ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン等のプラスチック担体等があげられる。これらは単独で用いてもよいし、又、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

[0338] 液体担体としては、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール等の一価アルコール類や、エチレングリコール、ジエチレングリコール、プロピレングリコール、ヘキシレングリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、グリセリン等の多価アルコール類に大別されるアルコール類、プロピレン系グリコールエーテル等の多価アルコール誘導体類、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン、イソホロン等のケトン類、エチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ノルマルパラフィン、ナフテン、イソパラフィン、ケロシン、鉱油等の脂肪族炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、ジイソプロピルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート、アジピン酸ジメチル等のエステル類、 γ -ブチロラクトン等のラクトン類、ジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセト

アミド、N-アルキルピロリジノン等のアミド類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメチルスルホキシド等の硫黄化合物類、大豆油、ナタネ油、綿実油、ヒマシ油等の植物油、水等をあげることができる。これらは単独で用いてもよいし、又、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

[0339] 界面活性剤は特に制限されないが、好ましくは水中でゲル化するか、あるいは膨潤性を示すものであり、例えばソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ショ糖脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪酸ジエステル、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンジアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテルホルマリン縮合物、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックポリマー、アルキルポリオキシエチレンポリプロピレンブロックポリマーエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアミン、ポリオキシエチレン脂肪酸アミド、ポリオキシエチレン脂肪酸ビスフェニルエーテル、ポリアルキレンベンジルフェニルエーテル、ポリオキシアルキレンスチリルフェニルエーテル、アセチレンジオール、ポリオキシアルキレン付加アセチレンジオール、ポリオキシエチレンエーテル型シリコーン、エステル型シリコーン、フッ素系界面活性剤、ポリオキシエチレンひまし油、ポリオキシエチレン硬化ひまし油等の非イオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、脂肪酸塩、ポリカルボン酸塩、N-メチルー脂肪酸サルコシネート、樹脂酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテルリン酸塩等のアニオン性界面活性剤、ラウリルアミン塩酸

塩、ステアリルアミン塩酸塩、オレイルアミン塩酸塩、ステアリルアミン酢酸塩、ステアリルアミノプロピルアミン酢酸塩、アルキルトリメチルアンモニウムクロライド、アルキルジメチルベンザルコニウムクロライド等のアルキルアミン塩等のカチオン界面活性剤、アミノ酸型又はベタイン型等の両性界面活性剤等があげられる。

[0340] これらの界面活性剤は1種を用いてもよいし、又、2種以上を組み合わせてもよい。

[0341] また、結合剤や粘着付与剤としては、例えばカルボキシメチルセルロースやその塩、デキストリン、水溶性デンプン、キサンタンガム、グアーガム、蔗糖、ポリビニルピロリドン、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、ポリビニルアセテート、ポリアクリル酸ナトリウム、平均分子量6000~20000のポリエチレングリコール、平均分子量10万~500万のポリエチレンオキサイド、天然燐脂質（例えばセファリン酸、レシチン等）等があげられる。

[0342] 増粘剤としては、例えばキサンタンガム、グアーガム、カルボキシメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、カルボキシビニルポリマー、アクリル系ポリマー、デンプン誘導体、多糖類のような水溶性高分子、高純度ベントナイト、ホワイトカーボンのような無機微粉等があげられる。

[0343] 着色剤としては、例えば酸化鉄、酸化チタン、プルシアンブルーのような無機顔料、アリザリン染料、アゾ染料、金属フタロシアニン染料のような有機染料等があげられる。

[0344] 拡張剤としては、例えばシリコーン系界面活性剤、セルロース粉末、デキストリン、加工デンプン、ポリアミノカルボン酸キレート化合物、架橋ポリビニルピロリドン、マレイン酸とスチレン類、メタアクリル酸共重合体、多価アルコールのポリマーとジカルボン酸無水物とのハーフエステル、ポリスチレンスルホン酸の水溶性塩等があげられる。

[0345] 展着剤としては、例えばジアルキルスルホコハク酸ナトリウム、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテ

ル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステルなどの種々の界面活性剤、パラフィン、テルペン、ポリアミド樹脂、ポリアクリル酸塩、ポリオキシエチレン、ワックス、ポリビニルアルキルエーテル、アルキルフェノールホルマリン縮合物、合成樹脂エマルション等があげられる。

[0346] 凍結防止剤としては、例えばエチレングリコール、ジエチレングリコール、プロピレングリコール、グリセリン等の多価アルコール類等があげられる。

[0347] 固結防止剤としては、例えばデンプン、アルギン酸、マンノース、ガラクトース等の多糖類、ポリビニルピロリドン、ホワイトカーボン、エステルガム、石油樹脂等があげられる。

[0348] 崩壊剤としては、例えばトリポリリン酸ソーダ、ヘキサメタリン酸ソーダ、ステアリン酸金属塩、セルロース粉末、デキストリン、メタクリル酸エステルの共重合体、ポリビニルピロリドン、ポリアミノカルボン酸キレート化合物、スルホン化スチレン・イソブチレン・無水マレイン酸共重合体、デンプン・ポリアクリロニトリルグラフト共重合体等があげられる。

[0349] 分解防止剤としては、例えばゼオライト、生石灰、酸化マグネシウムのような乾燥剤、フェノール系、アミン系、硫黄系、リン酸系等の酸化防止剤、サリチル酸系、ベンゾフェノン系等の紫外線吸収剤等があげられる。

[0350] 防腐剤としては、例えばソルビン酸カリウム、1, 2-ベンズチアゾリン-3-オン等があげられる。

[0351] 植物片としては、例えばおがくず、やしがら、トウモロコシ穂軸、タバコ茎、ケナフ茎等があげられる。

[0352] 本発明の除草剤において、上記添加成分を含有させる場合、その含有割合については、質量基準で、担体では通常5～95%、好ましくは20～90%、界面活性剤では通常0.1%～30%、好ましくは0.5～10%、その他の添加剤は0.1～30%、好ましくは0.5～10%の範囲で選ばれる。

[0353] 本発明の除草剤は、液剤、乳剤、水和剤、粉剤、油剤、顆粒水和剤、フロ

アブル剤、粒剤、ジャンボ剤、サスポエマルション、豆つぶ（登録商標）剤等の任意の剤型に製剤化して使用される。

[0354] この製剤化時に、他の除草剤、殺虫剤及び殺菌剤植物成長調整剤等の農薬から少なくとも１種類と薬害軽減剤や肥料等との混合組成物とすることもできる。

[0355] これらの製剤は適当な濃度に希釈して散布するか又は直接施用する。

[0356] 使用に際しては、本発明の一般式〔I〕で表される２－ピリドン誘導体又はその農薬上許容される塩はこれを単独で有効成分として使用することができる。

[0357] また、使用時に他の除草剤、殺虫剤及び殺菌剤植物成長調整剤等の農薬から少なくとも１種類、薬害軽減剤や肥料等と混合又は併用してもよい。

[0358] 混合又は併用してもよい公知の除草剤化合物、植物成長調整剤を以下に例示する。

[0359] キノクラミン (quinoclamine)、2, 3, 6－TBA、2, 4－D（アミン、ジエチルアミン、トリエタノールアミン、イソプロピルアミン、ナトリウム又はリチウム等との塩を含む）、2, 4－DB、DNOC（アミン又はナトリウム等の塩を含む）、EPTC、HOK－201、MCPA、MCPA・チオエチル (MCPA-thioethyl)、MCPB、S－メトラクロール (S-metolachlor)、TCA（ナトリウム、カルシウム又はアンモニア等との塩を含む）、TH－547（コード番号）、アイオキシニル (ioxynil, ioxynil-octanoate)、アクロニフェン (aclonifen)、アクロレイン (acrolein)、アザフェニジン (azafenidin)、アシフルオルフェン (acifluorfen-sodium)、アジムスルフロン (azimsulfuron)、アシュラム (asulam)、アセトクロール (acetochlor)、アトラジン (atrazine)、アニロホス (anilofos)、アミカルバゾン (amicarbazone)、アミドスルフロン (amidosulfuron)、アミトロール (amitrole)、アミノピラリド (aminopyralid)、アミノシクロピラクロール (aminocyclopyrachlor)、アメトリン (ametryn)、アラクロール (alachlor)、アロキシジム (alloxydim)、イソウロン (isouron)、

イソキサフルトール (isoxaflutole)、イソキサベン (isoxaben)、イソプロツロン (isoproturon)、イプフェンカルバゾン (ipfencarbazone、)、イマザキン (imazaquin)、イマザピク (imazapic) (アミン等との塩を含む)、イマザピル (imazapyr) (イソプロピルアミン等の塩を含む)、イマザメタベンズ (imazamethabenz-methyl)、イマザモックス (imazamox) (アミン塩等との塩を含む)、イマゼタピル (imazethapyr) (アミン塩等との塩を含む)、イマゾスルフロン (imazosulfuron)、インダノファン (indanofan)、エスプロカルブ (esprocarb)、エタメトスルフロン・メチル (ethametsulfuron-methyl)、エタルフルラリン (ethalfluralin)、エトキシスルフロン (ethoxysulfuron)、エトキシフェン (ethoxyfen-ethyl)、エトフメセート (ethofumesate)、エトベンザニド (etobenzanid)、オキサジアゾン (oxadiazon)、オキサジアルギル (oxadiargyl)、オキサジクロメフォン (oxaziclofomefone)、オキサスルフロン (oxasulfuron)、オキシフルオルフェン (oxyfluorfen)、オリザリン (oryzalin)、オルトスルファムロン (orthosulfamuron)、オルベンカルブ (orbencarb)、カフェンストロール (cafenstrole)、カルフェントラゾン・エチル (carfentrazone-ethyl)、カルブチレート (karbutilate)、カルベタミド (carbetamide)、キザロホップ・エチル (quizalofop-ethyl)、キザロホップ・P・エチル (quizalofop-P-ethyl)、キザロホップ・P・テフリル (quizalofop-P-tefuryl)、キンクロラック (quinclorac)、キンメラック (quinmerac)、クミルロン (cumyluron)、グリホサート (glyphosate) (ナトリウム、カリウム、アミン、プロピルアミン、イソプロピルアミン、ジメチルアミン又はトリメシウム等との塩を含む)、グルホシネート (glufosinate) (アミン又はナトリウム等との塩を含む)、クレトジム (clethodim)、クロジナホップ (clodinafop-propargyl)、クロピラリド (clopyralid)、クロマゾン (clomazone)、クロメプロップ (clomeprop)、クロランスラム・メチル (cloransulam-methyl)、クロリダゾン (chloridazon)、クロリムロン・エチル (chlorimuron-ethyl)、クロルスルフロン (chlorsulfuron)、クロルタル・ジメチル (chlorthal-dimethyl)、ク

ロルチアミド (chlorthiamid)、クロルフタリム (chlorphthalim)、クロルフ
フルレノール (chlorflurenol) (低級アルキルエステルを含む)、クロルプ
ロファム (chlorpropham)、クロロトルロン (chlorotoluron)、シアナジン
(cyanazine)、シアナミド (cyanamide)、ジウロン (diuron)、ジカンバ
(dicamba) (アミン、ジエチルアミン、イソプロピルアミン、ジグルコール
アミン、ナトリウム又はリチウム等との塩を含む)、シクロエート (cycloate)
e)、シクロキシジム (cycloxydim)、ジクロスラム (diclosulam)、シクロ
スルファムロン (cyclosulfamuron)、ジクロベニル (dichlobenil)、ジク
ロホップ・P・メチル (diclofop-P-methyl)、ジクロホップ・メチル (dicl
ofop-methyl)、ジクロルプロップ (dichlorprop)、ジクロルプロップ・P
(dichlorprop-P)、ジクワット (diquat(-dibromide))、ジチオピル (dith
iopyr)、シデュロン (siduron)、ジニトラミン (dinitramine)、シニドン
・エチル (cinidon-ethyl)、シノスルフロン (cinosulfuron)、ジノテルブ
(dinoterb)、シハロホップ・ブチル (cyhalofop-butyl)、ジフェナミド (d
iphenamid)、ジフェンゾコート (difenzoquat)、ジフルフェニカン (difl
ufenican)、ジフルフェンゾピル (diflufenzopyr)、シマジン (simazine)
、ジメタクロール (dimethachlor)、ジメタメトリン (dimethametryn)、ジ
メテナミド (dimethenamid)、シメトリン (simetryn)、ジメピペレート (d
imepiperate)、ジメフロン (dimefuron)、シンメチリン (cinmethylin)、
スルコトリオン (sulcotrione)、スルフエントラゾン (sulfentrazone)、
スルフォスルフロン (sulfosulfuron)、スルホメツロン・メチル (sulfomet
uron-methyl)、セトキシジム (sethoxydim)、ターバシル (terbacil)、ダ
イムロン (daimuron)、ダラポン (dalapon)、チアゾピル (thiazopyr)、
チエンカルバゾン (thiencarbazon)、チオベンカルブ (thiobencarb)、チ
ジアジミン (thidiazimin)、チフェンスルフロン・メチル (thifensulfuron
-methyl)、デスメディファム (desmedipham)、テニルクロール (thenylchl
or)、テブチウロン (tebuthiuron)、テプラロキシジム (tepraloxym)
、テフリルトリオン (tefuryltrione)、テルブチラジン (terbuthylazine)、

テルブトリン (terbutryn)、テルブメトン (terbumeton)、テンボトリオン (tembotrione)、トプラメゾン (topramezone)、トラルコキシジム (tralkoxydim)、トリアジフラム (triaziflam)、トリアスルフロン (triasulfuron)、トリアレート (tri-allate)、トリエタジン (trietazine)、トリクロピル (triclopyr(-butotyl))、トリトスルフロン (tritosulfuron)、トリフルスルフロン・メチル (triflusulfuron-methyl)、トリフルラリン (trifluralin)、トリフロキシスルフロンナトリウム塩 (trifloxysulfuron-sodium)、トリベヌロン・メチル (tribenuron-methyl)、ナプタラム (naptalam) (ナトリウム等との塩を含む)、ナプロパミド (napropamide)、ニコスルフロン (nicosulfuron)、ネブロン (neburon)、ノルフルラゾン (norflurazon)、パラコート (paraquat dichloride)、ハロキシホップ (haloxyfop-methyl)、ハロキシホップ・P・メチル (haloxyfop-P-methyl)、ハロスルフロン・メチル (halosulfuron-methyl)、ピクロラム (picloram)、ピコリナフェン (picolinafen)、ビスピリバック・ナトリウム塩 (bispyribac-sodium)、ピノキサデン (pinoxaden)、ビフェノックス (bifenox)、ピペロホス (piperophos)、ピラクロニル (pyraclonil)、ピラスルホトール (pyrasulfotole)、ピラゾキシフェン (pyrazoxyfen)、ピラゾスルフロン・エチル (pyrazosulfuron-ethyl)、ピラゾレート (pyrazolynate)、ビアラホス (bifenox-sodium) ピラフルフェン・エチル (pyraflufen-ethyl)、ピリダフォル (pyridafol)、ピリチオバック・ナトリウム塩 (pyrithiobac-sodium)、ピリデート (pyridate)、ピリフタリド (pyriftalid)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、ピリベンゾキシム (pyribenzoxim)、ピリミスルファン (pyrimisulfan)、ピリミノバック・メチル (pyriminobac-methyl)、ピロキサスルホン (pyroxasulfone)、ピロクススラム (pyroxsulam)、フェノキサプロップ・P・エチル (fenoxaprop-P-ethyl)、フェントラザミド (fentrazamide)、フェンメディファム (phenmedipham)、フォラムスルフロン (foramsulfuron)、ブタクロール (butachlor)、ブタフェナシル (butafenacil)、ブタミホス (butamifos)、ブチレート (butylate)、ブトラリン (butralin)

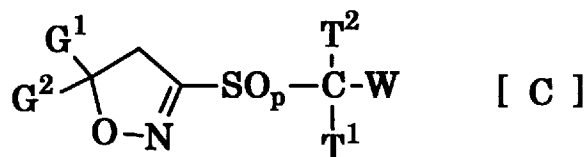
、ブトロキシジム (butoxydim)、フラザスルフロン (flazasulfuron)、フラムプロップ・メチル (flamprop-methyl)、フラムプロップ・M・メチル (flamprop-M-methyl)、フラムプロップ・エチル (flamprop-ethyl)、フラムプロップ・イソプロピル (flamprop-isopropyl)、フラムプロップ・M・イソプロピル (flamprop-M-isopropyl)、プリミスルフロン (primisulfuron-methyl)、フルアジホップ (fluazifop-butyl)、フルアジホップ・P (fluazifop-P-butyl)、フルオメツロン (fluometuron)、フルオログリコフェン (fluoroglycofen-ethyl)、フルカルバゾン・ナトリウム塩 (flucarbazone-sodium)、フルセトスルフロン (flucetosulfuron)、フルチアセット・メチル (fluthiacet-methyl)、フルピルスルフロン (flupyrsulfuron-methyl-sodium)、フルフェナセット (flufenacet)、フルフェンピル・エチル (flufenpyr-ethyl)、フルプロパネート・ナトリウム塩 (flupropanate-sodium)、フルポキサム (flupoxam)、フルミオキサジン (flumioxazin)、フルミクロラック・ペンチル (flumiclorac-pentyl)、フルメツラム (flumetsulam)、フルリドン (fluridone)、フルルタモン (flurtamone)、フルロキシピル (fluroxypyr)、フルロクロリドン (flurochloridone)、プレチラクロール (pretilachlor)、プロジアミン (prodiamine)、プロスルフロン (prosulfuron)、プロスルホカルブ (prosulfocarb)、プロパキザホップ (propaquizafop)、プロパクロール (propachlor)、プロパジン系 (propazine)、プロパニル (propanil)、プロピザミド (propyzamide)、プロピソクロール (propisochlor)、プロファム (propham)、プロポキシカルバゾン・ナトリウム塩 (propoxycarbazine-sodium)、プロホキシジム (profoxydim)、ブロマシル (bromacil)、プロメトリン (prometryn)、プロメトン (prometon)、ブロモキシニル (bromoxynil) (酪酸、オクタン酸又はヘプタン酸等とのエステル体を含む)、ブロモブチド (bromobutide)、フロラスラム (florasulam)、ヘキサジノン (hexazinone)、ペトキサミド (pethoxamid)、ベナゾリン (benazolin)、ペノキススラム (penoxsulam)、ベフルブタミド (beflubutamid)、ペブレート (pebulate)、ベンカルバゾン (bencarbazine)、ペンディメタリ

ン (pendimethalin)、ベンズフェンジゾン (benzfendizone)、ベンスリド (bensulide)、ベンスルフロン・メチル (bensulfuron-methyl)、ベンゾビシクロン (benzobicyclon)、ベンゾフェナップ (benzofenap)、ベントゾン (bentazone) (ナトリウム等との塩を含む)、ペンタノクロール (pentanochlor)、ペントキサゾン (pentoxazone)、ベンフルラリン (benfluralin)、ベンフレセート (benfuresate)、ホサミンアンモニウム (fosamine-ammonium)、ホメサフェン (fomesafen)、メコプロップ (mecoprop-potassium)、メコプロップ・P・カリウム塩 (mecoprop-P)、メソスルフロン・メチル (mesosulfuron-methyl)、メソトリオン (mesotrione)、メタザクロール (metazachlor)、メタベンズチアズロン (methabenzthiazuron)、メタミトロン (metamitron)、メタミホップ (metamifop)、メチルダイムロン (methyldymron)、メトキサロン (metoxuron)、メトスラム (metosulam)、メトスルフロン・メチル (metsulfuron-methyl)、メトラクロール (metolachlor)、メトリブジン (metribuzin)、メフェナセツト (mefenacet)、モノリニュロン (monolinuron)、モリネート (molinate)、ヨードスルフロンメチルナトリウム塩 (iodosulfuron-methyl-sodium)、ラクトフェン (lactofen)、リニュロン (linuron)、リムスルフロン (rimsulfuron)、レナシル (lenacil)、サフルフェナシル (saflufenacil)、アミプロホス・メチル (amiprofos-methyl)、アンシミドール (ancymidol)、イソキサクロルトール (isoxachlortole) エチジムロン (ethidimuron)、クロメトキシフェン (chlomethoxyfen)、クロランベン (chloramben)、クロルブロムロン (chlorbromuron)、クロロクスロン (chloroxuron)、チオカルバジル (tiocarbazil)、デスメトリン (desmetryne)、テブタム (tebutam)、ナプロアニリド (naproanilide)、バーナレート (vernolate)、フェニュロン (fenuron)、フルアゾレート (fluazolate)、プロフルアゾール (profluazol)、メトブロムロン (metobromuron)、メトベンズロン (metobenzuron)、AE-F-150944 (コード番号) SYP-298 (コード番号) SYP-300 (コード番号) HOK-201 (コード番号) NC-620 (コード番号) 1-ナフ

チルアセトアミド (α -naphthalene acetamide)、1-メチルシクロプロペン (1-methylcyclopropene)、2, 6 - ジイソプロピルナフタレン (2,6-diisopropylnaphthalene)、4-CPA、アビグリシン (aviglycine)、アンシミドール (ancymidol)、イナベンフィド (inabenfide)、インドール酢酸 (indole acetic acid)、インドール酪酸 (indole butyric acid)、ウニコナゾール (uniconazole)、ウニコナゾール・P (uniconazole-P)、エチクロゼート (ethychlozate)、エテホン (ethephon)、カルボネ (carvone)、クロキシホナック (cloxyfonac-sodium)、クロキシホナック・カリウム塩 (cloxyfonac-potassium)、クロプロップ (cloprop)、クロルメコート (chlormequat)、サイトカイニン (cytokinins)、シクラニリド (cyclanilide)、ジケグラック (dikegulac)、ジベレリン (gibberellic acid)、ジメチピン (dimethipin)、シントフェン (sintofen)、ダミノジット (daminozide)、チジアズロン (thidiazuron)、デシルアルコール (n-decanol)、トリアコンタノール (1-triacontanol)、トリネキサパック・エチル (trinexapac-ethyl)、パクロブトラゾール (paclobutrazol)、フルメトラリン (flumetralin)、フルルプリミドール (flurprimidol)、フルレノール (flurenol)、プロヒドロジャスモン (prohydrojasmon)、プロヘキサジオン・カルシウム塩 (prohexadione-calcium)、ベンジルアミノプリン ((6-)-benzylaminopurine)、ホルクロルフェニユロン (forchlorfenuron)、マレイン酸ヒドラジド (maleic hydrazide)、メピコート・クロリド (mepiquat)、メフルイジド (mefluidide)、メプチルジノカップ (meptyldinocap)、インダジフラム (indaziflam)、プロピリスルフロン (propyrisulfuron)、メチオゾリン (methiozolin)、xazasulfuron (dioxasulfuron)、ビスクロピロン (bicyclopyrone)、メタゾスルフロン (metazosulfuron)、heptamaloxylglucan、EL101GV (コード番号)、ジメチルジスルフィド及び次の式 [C]

[0360]

[化25]



[0361] [式中、 p は0～2の整数を表し、 T^1 及び T^2 は互いに独立して水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル基又は $C_1 \sim C_6$ アルキル基を示し、 G^1 及び G^2 は互いに独立して、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基を示し、 W は（1～5個の同一又若しくは相異なる V で置換された）フェニル基を表し、 V は水素原子、{同一若しくは相異なる1～3個のハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、水酸基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルアミノ基、シアノ基又は（置換されていてもよい。）フェノキシで置換されていてもよい} $C_1 \sim C_6$ アルキル基、（同一若しくは相異なる1～3個のハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル基、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル基又は $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基で置換されていてもよい。） $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキルオキシ基或いはハロゲン原子を表す。]で示されるイソオキサゾリン誘導体などが挙げられる。

[0362] 混合又は併用してもよい公知の殺菌剤化合物を例示する。

[0363] A F - 0 2 0 1（コード番号）、BAG-010（コード番号）、BAF-045（コード番号）、BYF-14182（コード番号）、copper dioctanoate、DBEDC、I K F - 3 0 9（コード番号）、O K - 5 2 0 3（コード番号）、S - 2 1 8 8（コード番号）、SYP-Z-048（コード番号）、T P T A、T P T C、T P T H、アシベンゾラル・S・メチル（acibenzolar-S-methyl）、アゾキシストロビン（azoxystrobin）、アミスルブロム（amisulbrom）、アルジモルフ（aldimorph）、硫黄（sulfur）、イソチアニル（isotianil）、イソピラザム（isopyrazam）、イソプロチオラン（isoprothiolane）、イプコナゾール（ipconaz

ole)、イプロジオン (iprodione)、イプロバリカルブ (iprovalicarb)、イプロベンホス (iprobenfos)、イマザリル (imazalil)、イミノクタジン・アルベシル酸塩 (iminooctadine-albesilate)、イミノクタジン酢酸塩 (iminooctadine-triacetate)、イミベンコナゾール (imibenconazole)、エジフェンホス (edifenphos)、エタボキサム (ethaboxam)、エトキシキン (ethoxyquin)、エトリジアゾール (etridiazole)、エネストロブリン (enestroburin)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、塩基性塩化銅 (copper oxychloride)、オキサジキシル (oxadixyl)、オキサジニラゾール (oxazinylazole)、オキシカルボキシン (oxycarboxin)、オキシキノリン銅 (oxine-copper)、オキシテトラサイクリン (oxytetracycline)、オキスポコナゾールフマル酸塩 (oxpoconazole fumarate)、オキシリニック酸 (oxolinic acid)、オクチリノン (octhilinone)、オフラセ (ofurace)、オリサストロビン (orysastrobin)、オルソフェニルフェノール (o-phenylphenol)、カスガマイシン (kasugamycin)、カプタホール (captafol)、カルプロパミド (carpropamid)、カルベンダジム (carbendazim)、カルボキシン (carboxin)、キノキシフェン (quinoxifen)、キノメチオネート (chinomethionat)、キャプタン (captan)、銀 (silver)、キントゼン (quintozene)、グアザチン (guazatine)、クレソキシム・メチル (kresoxim-methyl)、クロロタロニル (chlorothalonil)、クロロネブ (chloroneb)、酸化第一銅 (cuprous oxide)、シアゾファミド (cyazofamid)、ジエトフェンカルブ (dietfencarb)、ジクロシメット (diclocymet)、ジクロフルアニド (dichlofluanid)、ジクロメジン (diclomezine)、ジクロラン (dicloran)、ジチアノン (dithianon)、ジニコナゾール (diniconazole)、ジネブ (zineb)、ジノカップ (dinocap)、ジフェニール (biphenyl)、ジフェニルアミン (diphenylamine)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、ジフェンゾコート (difenzoquat metilsulfate)、シフルフェナミド (cyflufenamid)、ジフルメトリム (diflumetorim)、シプロコナゾール (cyproconazole)、シプロジニル (cyprodinil)、シメコナゾール (simeconazole)、ジメトモルフ

(dimethomorph)、シモキサニル (cymoxanil)、ジモキシストロビン (dimoxystrobin)、ジラム (ziram)、シルチオフアム (silthiofam)、水酸化第二銅 (copper hydroxide)、ストレプトマイシン (streptomycin)、スピロキサミン (spiroxamine)、ゾキサミド (zoxamide)、ダゾメット (dazomet)、炭酸水素カリウム (potassium bicarbonate)、チアジニル (tiadinil)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チオフアネート・メチル (thiophanate-methyl)、チフルザミド (thifluzamide)、チラム (thiram)、テクナゼン (tecnazene)、テクロフタラム (tecloftalam)、テトラコナゾール (tetraconazole)、デバカルブ (debacarb)、テブコナゾール (tebuconazole)、ドジン (dodine)、ドデモルフ (dodemorph)、トリアジメノール (triadimenol)、トリアジメホン (triadimefon)、トリアゾキシド (triazoxide)、トリシクラゾール (tricyclazole)、トリチコナゾール (triticonazole)、トリデモルフ (tridemorph)、トリフルミゾール (triflumizole)、トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)、トリホリン (triforine)、トリルフルアニド (tolylfluanid)、トルクロホス・メチル (tolclofos-methyl)、トルニファニド (tolnifanide)、ナーバム (nabam)、ニトロタル・イソプロピル (nitrothal-isopropyl)、ヌアリモール (nuarimol)、バリダマイシン (validamycin)、ビキサフェン (bixafen)、ピコキシストロビン (picoxystrobin)、ビテルタノール (bitertanol)、ピペラリン (piperalin)、ヒメキサゾール (hymexazol)、ピラクロストロビン (pyraclostrobin)、ピラゾホス (pyrazophos)、ピリフェノックス (pyrifenox)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、ピリベンカルブ (pyribencarb)、ピリメタニル (pyrimethanil)、ピロキロン (pyroquilon)、ビンクロゾリン (vinclozolin)、ファーバム (ferbam)、ファモキサドン (famoxadone)、フェナミドン (fenamidone)、フェナリモール (fenarimol)、フェノキサニル (fenoxanil)、フェリムゾン (ferimzone)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、フェンフラム (fenfuram)、フェンプロピジン (fenpropidin)、フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、フェンヘキサミド (fenhexamid)、フォルペッ

ト (folpet)、フサライド (phthalide)、ブピリメート (bupirimate)、フベリダゾール (fuberidazole)、フラメトピル (furametpyr)、フララキシル (furalaxyl)、フルアジナム (fluazinam)、フルオキサストロビン (fluoxastrobin)、フルオピコリド (fluopicolide)、フルオピラム (fluopyram)、フルオルイミド (fluoroimide)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フルジオキシニル (fludioxonil)、フルシラゾール (flusilazole)、フルスルファミド (flusulfamide)、フルトラニル (flutolanil)、フルトリアホール (flutriafol)、フルモルフ (flumorph)、プロキナジド (proquinazid)、プロクロラズ (prochloraz)、プロシミドン (procymidone)、プロチオコナゾール (prothioconazole)、ブロンポール (bronopol)、プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarb-hydrochloride)、プロピコナゾール (propiconazole)、プロピネブ (propineb)、プロベナゾール (probenazole)、ブロムコナゾール (bromuconazole)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、ベナラキシル (benalaxyl)、ベナラキシル・M (benalaxyl-M)、ベノミル (benomyl)、ペフラゾエート (pefurazoate)、ペンコナゾール (penconazole)、ペンシクロン (pencycuron)、ベンチアバリカルブ・イソプロピル (benthiavalicarb-isopropyl)、ペンチオピラド (penthioopyrad)、ボスカリド (boscalid)、ホセチル (fosetyl-aluminium)、ポリオキシシン (polyoxin)、ポリカーバメート (polycarbamate)、ボルドー液 (Bordeaux mixture)、マンカップパー (mancopper)、マンコゼブ (mancozeb)、マンジプロパミド (mandipropamid)、マンネブ (maneb)、ミクロブタニル (myclobutanil)、ミルディオマイシン (mildiomycin)、メタスルホカルブ (methasulfocarb)、メタム (metam)、メタラキシル (metalaxyl)、メタラキシル・M (metalaxyl-M)、メトコナゾール (metconazole)、メトミノストロビン (metominostrobin)、メトラフェノン (metrafenone)、メパニピリム (mepanipyrim)、メプロニル (mepronil)、硫酸オキシキノリン (oxyquinoline sulfate)、硫酸銅 (copper sulfate)、セダキサン (sedaxane)、ペンフルフェン (penflufen)、trimetopyr(erysicos)、fenpyrazamine(ipfenpyrazolone)、バ

リフェナレート (valifenalate)、テブフロキン (tebufloquin)、ピラメトストロビン (pyrametostrobin)、アメトクラジン (ametocetradin)、fluxapyroxad、pyroxazole、pyrisoxazole、pyraromaxazole、chlorodincarbamate 及びノニルフェノールスルホン酸銅 (copper (nonylphenyl) sulfonate)、ジメチルジスルフィド (dimethyl disulfide)、硝酸銀 (silver nitrate)。

[0364] 混合又は併用してもよい公知の殺虫剤、殺線虫剤化合物を例示する。

[0365] 1, 3 ジクロロプロペン (1, 3-dichloropropene)、CL 9 0 0 1 6 7 (コード番号)、cryolite、DCIP、DNOC、EPN、RU 1 5 5 2 5 (コード番号)、XMC、ZXI 8 9 0 1 (コード番号)、アクリナトリン (acrinathrin)、アザメチホス (azamethiphos)、アジンホス・エチル (azinphos-ethyl)、アジンホス・メチル (azinphos-methyl)、アセキノシル (acequinocyl) アセタミプリド (acetamiprid)、アセトプロール (acetoprol)、アセフェート (acephate)、アゾシクロチン (azocyclotin)、アバメクチン (abamectin)、アミトラズ (amitraz)、アラニカルブ (alanycarb)、アルジカルブ (aldicarb)、アルファーシペルメトリン (alpha-cypermethrin)、アレスリン (allethrin)、イソキサチオン (isoxathion)、イソフェンホス (isofenphos-methyl)、イソカルボホス (isocarbophos)、イソプロカルブ (isoprocarb)、イミシアホス (imicyafos)、イミダクロプリド (imidacloprid)、イミプロトリン (imiprothrin)、インドキサカルブ (indoxacarb)、エスフェンバレレート (esfenvalerate)、エチオフェンカルブ (ethiofencarb)、エチオン (ethion)、エチプロール (ethiprole)、エトキサゾール (etoxazole)、エトフェンプロックス (etofenprox)、エトプロホス (ethoprophos)、エマメクチン (emamectin)、エンドスルファン (endosulfan)、エンペントリン (empenthrin)、オキサミル (oxamyl)、オキシジメトン・メチル (oxydemeton-methyl)、オメトエート (omethoate)、カズサホス (cadusafos)、カランジ (karanjin)、カルタップ (cartap)、カルバリル (carbaryl)、カルボスルファン (carbosulfan)、カルボフラン (carbofuran)、ガンマ・シハロトリン (gamma-cyhalothrin)、キシリルカルブ (xylylcarb)、キナルホス (quinalphos)、キノプレ (kinoprene)、キノメチオネート (c

hinomethionat)、クマホス(coumaphos)、クロチアニジン(clothianidin)、クロフェンテジン(clofentezine)、クロマフェノジド(chromafenozide)、クロラントラニリプロール(chlorantraniliprole)、クロルエトキシホス(chlorethoxyfos)、クロルデン(chlordane)、クロルピクリン(chloropicrin)、クロルピリホス(chlorpyrifos)、クロルピリホス・メチル(chlorpyrifos-methyl)、クロルフェナピル(chlorfenapyr)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、クロルフルアズウロン(chlorfluazuron)、クロルメホス(chlormephos)、シアジピル(cyazypyr)シアノホス(cyanophos)、ジアフェンチウロン(di afenthion)、ジエノクロル(dienochlor)、シエノピラフェン(cyenopyrafen)、ジクロトホス(dicrotophos)、ジクロフェンチオン(dichlofenthion)シクロプロトリン(cycloprothrin)、ジクロルボス(dichlorvos)、ジコホル(dicofol)、ジシクラニル(dicyclanil)、ジスルホトン(disulfoton)、ジノテフラン(dinotefuran)、ジノブトン(dinobuton)、シハロトリン(cyhalothrin)、シフェノトリン(cyphenothrin)、シフルトリン(cyfluthrin)、ジフルベンズウロン(diflubenzuron)、シフルメトフェン(cyflumetofen)、ジフロビダジン(diflovidazin)、シヘキサチン(cyhexatin)、シペルメトリン(cypermethrin)、ジメチルビンホス(dimethylvinphos)、ジメトエート(dimethoate)、シラフルオフエン(silafluofen)、シロマジン(cyromazine)、スピネトラム(spinetoram)、スピノサド(spinosad)、スピロジクロフェン(spirodiclofen)、スピロテトラマト(spirotetramat)、スピロメシフェン(spiromesifen)、スルコフロン(sulcofuron-sodium)スルフラミド(sulflamid)、スルホテップ(sulfotep)、スルホキサフロール(sulfoxaflor、IUPAC名:[methyl(oxo){1-[6-(trifluoromethyl)-3-pyridyl]ethyl}-λ 6-sulfanylidene]cyanamide)ゼタ・シペルメトリン(zeta-cypermethrin)、ダイアジノン(diazinon)、タウフルバリネート(tau-fluvalinate)、チアクロプリド(thiacloprid)、チアメトキサム(thiamethoxam)、チオジカルブ(thiodicarb)、チオシクラム(thiocyclam)、チオスルタップ(thiosultap)、チオファノックス(thiofanox)、チオメトン(thiometon)、テトラクロルビンホス(tetrachlorvinphos)、

テトラジホン (tetradifon) テトラメスリン (tetramethrin)、テブピリムホス (tebupirimfos)、テブフェノジド (tebufenozide)、テブフェンピラド (tebufenpyrad)、テフルトリン (tefluthrin)、テフルベンズウロン (teflubenzuron)、デメトン・S・メチル (demeton-S-methyl)、テメホス (temephos)、デルタメトリン (deltamethrin)、テルブホス (terbufos)、トラロメトリン (tralomethrin)、トランスフルトリン (transfluthrin)、トリアザメート (triazamate)、トリアゾホス (triazophos)、トリクロルホン (trichlorfon)、トリフルムロン (triflumuron)、トリメタカルブ (trimethacarb)、トルフェンピラド (tolfenpyrad)、ナレド (naled)、ニコチン (nicotine) ニテンピラム (nitenpyram)、ノバルロン (novaluron)、ノビフルムロン (noviflumuron)、ハイドロプレネ (hydroprene)、バミドチオン (vamidothion)、パラチオン (parathion)、パラチオン・メチル (parathion-methyl)、ハルフェンプロックス (halfenprox)、ハロフェノジド (halofenozide)、バイオアレスリン (bioallethrin)、バイオレスメトリン (bioresmethrin)、ビストリフルロン (bistrifluron)、ヒドラメチルノン (hydramethylnon)、ビフェナゼート (bifenazate)、ビフェントリン (bifenthrin)、ピメトロジン (pymetrozine)、ピラクロホス (pyraclofos)、ピリダフェンチオン (pyridaphenthion)、ピリダベン (pyridaben)、ピリダリル (pyridalyl)、ピリフルキナゾン (pyrifluquinazon)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)、ピリミカルブ (pirimicarb)、ピリミジフェン (pyrimidifen)、ピリミホス・メチル (pirimiphos-methyl)、ファミフル (famphur)、フィプロニル (fipronil)、フェナザキン (fenazaquin)、フェナミホス (fenamiphos)、フェニトロチオン (fenitrothion)、フェノキシカルブ (fenoxycarb)、フェノチオカルブ (fenothiocarb)、フェノトリン (phenothrin)、フェノブカルブ (fenobucarb)、フェンチオン (fenthion)、フェントエート (phenthoate)、フェンバレレート (fenvalerate)、フェンピロキシメート (fenpyroximate)、フェンブタンチン・オキシド (fenbutatin oxide)、フェンプロパトリン (fenpropathrin)、ブトカルボキシム (butocarboxim)、ブトキシカルボキシム (butoxycarboxim)、ブプロフェジン (buprofezin)、フラチオカルブ (furathioc

arb)、プラレトリン(prallethrin)、フルアクリピリム(flucacrypyrim)、フルシクロクスロン(flucycloxuron)、フルシトリネート(flucythrinate)、フルスルファミド(flusulfamide)、フルバリネート (fluvalinate) 、フルピラゾホス(flupyrzofos)、フルフェネリム (flufenerim) 、フルフェノクスウロン(flufenoxuron)、フルベンジアミド(flubendiamide)、フルメトリン(flumethrin)、フルリムフェン(flurimfen)、プロチオホス(prothiofos)、フロニカミド(flonicamid)、プロパホス (propaphos) プロパルギット (propargite) プロフェノホス(profenofos)、プロペタムホス(propetamphos)、プロポキスル(propoxur)、ブromoプロピレート(bromopropylate)、ベータ・シフルトリン(beta-cyfluthrin)、ヘキサチアゾクス(hexythiazox)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ヘプテノホス(heptenophos)、ペルメトリン(permethrin)、ベンスルタップ(bensultap)、ベンゾキシメート (benzoximate) 、ベンダイオカルブ(bendiocarb)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、ホキシム(phoxim)、ホサロン(phosalone)、ホスチアゼート(fosthiazate)、ホスファミドン(phosphamidon)、ホスメット(phosmet)、ホルメタネート(formetanate)、ホレート(phorate)、マラチオン(malathion)、ミルベメクチン (milbemectin) メカルバム(mecarbam)、メスルフェンホス (mesulfenfos) 、メソミル(methomyl)、メタフルミゾン(metaflumizon)、メタミドホス(methamidophos)、メタム (metham) 、メチオカルブ(methiocarb)、メチダチオン(methidathion)、メチルイソチオシアネート(methyl isothiocyanate)、メトキシクロル (methoxychlor) 、メトキシフェノジド(methoxyfenozide)、メトトリン(methothrin)、メトフルトリン (metofluthrin) 、メトプレン(methoprene)、メビンホス(mevinphos)、モノクロトホス(monocrotophos)、ラムダ・シハロトリン(lambda-cyhalothrin)、ルフェヌロン(lufenuron)、レスメトリン(resmethrin)、レピメクチン(lepmectin)、ロテノン (rotenone) 、シアジピル(cyazypyr)、シアントラニリプロール (cyantraniliprole) 、スルホキサフロル (sulfoxaflor) 、ピリフルキナゾン(pyrifluquinazone)、thiazosulfen、tetramethylfluthrin、meperfluthrin、fluphprole、dicloxystrobin、enaminostrobin、cyprop

ene、及びN I - 3 0（コード番号）。

[0366] 混合又は併用してもよい公知の薬害軽減化合物を例示する。

[0367] ベノキサコル (benoxacor)、フリラゾール (furilazole)、ジクロルミド (dichlormid)、ジシクロノン (dicyclonone)、DKA-24 (N1, N2-ジアリル-N2-ジクロロアセチルグリシンアミド)、AD-67 (4-ジクロロアセチル-1-オキサー-4-アザスピロ [4. 5] デカン)、PPG-1292 (2, 2-ジクロロ-N- (1, 3-ジオキサン-2-イルメチル)-N- (2-プロペニル) アセトアミド)、R-29148 (3-ジクロロアセチル-2, 2, 5-トリメチル-1, 3-オキサゾリジン)、クロキントセト-メキシル (cloquintoet-mexyl)、ナフタル酸無水物 (1,8-Naphthalic Anhydride)、メフェンピル-ジエチル (mefenpyr-diethyl)、メフェンピル (mefenpyr)、メフェンピルエチル (mefenpyr-ethyl)、フェンクロラゾール-エチル (fenchlorazole 0 ethyl)、フェンクロリム (fenclo rim)、MG-191 (2-ジクロロメチル-2-メチル-1, 3-ジオキサン)、シオメトリニル (cyometrinil)、フルラゾール (flurazole)、フルキソフェニム (fluxofenim)、イソキサジフェン (isoxadifen)、イソキサジフェン-エチル (isoxadifen-ethyl)、メコプロップ (mecoprop)、MCPA、ダイムロン (daimuron)、2, 4-D、MON4660 (コード番号)、オキサベトリニル (oxabetrinil)、シプロスルファミド (cyprosulfamide) 及びTI - 35 (コード番号)。

[0368] 本発明の除草剤における有効成分の配合割合については、必要に応じて適宜選ばれるが、粉剤又は粒剤等とする場合は0. 01~10% (重量)、好ましくは0. 05~5% (重量) の範囲から適宜選ぶのがよい。乳剤及び水和剤等とする場合は1~50% (重量)、好ましくは5~30% (重量) の範囲から適宜選ぶのがよい。又、フロアブル剤等とする場合は1~40% (重量)、好ましくは5~30% (重量) の範囲から適宜選ぶのがよい。

[0369] 本発明の除草剤の施用量は、使用される化合物の種類、対象雑草、発生傾向、環境条件ならびに使用する剤型等によって変わるが、粉剤及び粒剤等の

ようにそのまま使用する場合は、有効成分として1ヘクタール当り1g～50kg、好ましくは10g～10kgの範囲から適宜選ぶのがよい。又、乳剤、水和剤及びフロアブル剤等とする場合のように液状で使用する場合は、0.1～50,000ppm、好ましくは10～10,000ppmの範囲から適宜選ぶのがよい。

[0370] 本発明の除草剤は、畑地、水田又は果樹園等において茎葉散布、土壌施用又は水面施用等により使用することができる。又、本発明の除草剤は、休耕田畑、畦畔、農道、水路、牧草造成地、墓地、公園、道路、運動場、建物の周辺の空き地、開墾地、線路端、森林等の一般雑草の駆除のために使用することもできる。さらに有用作物の種子又は塊茎に塗布、粉衣、被膜又は浸漬等の処理をして使用することもできる。

[0371] 本発明の除草剤は、畑地において問題となる種々の雑草、例えばオオイヌタデ、イヌタデ、ギシギシ等のタデ類、アオビユ、オオホナガアオゲイトウ、アオゲイトウ等のヒユ類、ワルナズビ、イヌホオズキ、シロザ、イチビ、アメリカキンゴジカ、アメリカツノクサネム、ブタクサ、ヒナゲシ、アサガオ、オナモミ、ハコベ、カミツレ、イヌカミツレ、ホウキギ、カミツレモドキ、オオブタクサ、ツユクサ、ヤエムグラ、スミレ、オオイヌノフグリ、フラサバソウ、ホトケノザ、カラスノエンドウ、ノボロギク、ナズナ、ロシアアザミ、コチア、ヒメオドリコソウ、イヌカミツレ、エゾノキツネアザミ、オオブタクサ等の広葉雑草をはじめ、ハマスゲ、キハマスゲ、ヒメクグ、カヤツリグサ、コゴメガヤツリ等の多年生及び1年生カヤツリグサ科雑草、ヒエ、メヒシバ、エノコログサ、スズメノカタビラ、スズメノテッポウ、ジョンソングラス、ノスズメノテッポウ、ネズミムギ、野生エンバク、メリケンクキビ等のイネ科雑草の発芽前から生育期の広い範囲にわたって優れた除草効果を発、揮する。又、水田に発生するタイヌビエ、イヌビエ、メリケンクキビ、タマガヤツリ、アゼガヤ、コナギ、アメリカアゼナ、アゼナ、キカシグサ、アゼトウガラシ、ククモ、ヒメミソハギ、ミゾハコベ、ミズアオイ、チョウジタデ、タカサブロウ、アメリカセンダングサ、クサネム、イボ

クサ等の一年生雑草、及びウリカワ、オモダカ、ミズガヤツリ、クログワイ、ホタルイ、イヌホタルイ、タイワンヤマイ等のカヤツリ草科雑草、ヘラオモダカ、シズイ、コウキヤガラ、ヒルムシロ、アシカキ、キシウスズメノヒエ、エゾノサヤヌカグサ、マツバイ、チゴザサ等の多年生雑草を防除することもできる。

[0372] 更に、本発明の除草剤は有用植物及び有用作物に対する安全性が高く、例えば、イネ、コムギ、オオムギ、エンバク、ライムギ、アワ、キビ、トウモロコシ及びグレインソルガム等の穀物類、ダイズ、ワタ、テンサイ、サトウキビ、タマネギ、ヒマワリ、ナタネ、ピーナッツ、アマ、タバコ、コーヒー、サツマイモ、ジャガイモ、トマト及びその他の野菜類又はシバ等に対して高い安全性を示す。

[0373] ここで言う有用作物及び有用植物とは、遺伝子技術によって形質転換され、除草剤や害虫、病害などに対して耐性を示すトウモロコシ、ダイズ、ワタ、ナタネ、サトウキビ等のいわゆる遺伝子組み換え作物や育種、選抜によって除草剤や害虫、病害などに耐性を示す植物も含んでいる。

[0374] 以下、本発明化合物である式 [I] の製造方法、製剤例並びに用途を下記の実施例で詳細に説明するが、本発明はこれら実施例に何ら制約されるものではない。

[0375] なお、以下の説明において「%」は質量百分率を示し、「部」は質量部を示す。

実施例 1

[0376] 3-（2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル）-1-メチルキノリン-2（1H）-オン（本発明の化合物番号 I-2）の製造

[0377] （1）3-オキソ-1-シクロヘキセニル 1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボキシレートの製造
1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 0.76 g（3.7 mmol）をジクロロメタン（50 mL）に溶解し、塩化

オキザリル 1.0 mL (12 mmol) を加えた。この混合物に N, N-ジメチルホルムアミド 2 滴を加えて 40 °C で 1 時間攪拌した。この反応溶液を減圧下濃縮し、1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸クロリドを得た。得られた酸クロリドをアセトニトリル (30 mL) に溶解し、この溶液を 1, 3-シクロヘキサジオン 0.46 g (4.1 mmol) とトリエチルアミン 0.63 mL (4.5 mmol) のアセトニトリル (50 mL) 溶液に氷冷下で添加し、室温で 1 晩攪拌した。この反応混合物を、水にあげ、酢酸エチルで抽出し、有機相を水、炭酸水素ナトリウム水溶液、水の順で洗浄後、乾燥、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 4 ~ 1 : 0) で精製し、淡黄色粉末の標記化合物を 0.48 g (収率 43%) 得た。

[0378] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

2.10-2.16 (2H, m)、2.47 (2H, t)、2.73 (2H, t)、3.77 (3H, s)、6.04 (1H, s)、7.32 (1H, t)、7.40 (1H, d)、7.70-7.75 (1H, m)、8.53 (1H, s)

[0379] (2) 3-(2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル)-1-メチルキノリン-2(1H)-オンの製造

3-オキソ-1-シクロヘキセニル 1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボキシレート 0.48 g (1.6 mmol) をアセトニトリル (40 mL) に溶解し、この溶液にトリエチルアミン 0.25 mL (1.8 mmol) とアセトンシアノヒドリン 0.15 g (1.8 mmol) を加え、室温で一昼夜攪拌した。反応混合物を飽和重曹水にあげ、酢酸エチルで洗浄した。水相にクエン酸を加えて pH 3~4 とし、酢酸エチルで抽出し、有機相を水洗、乾燥、濃縮した。残渣にジイソプロピルエーテルを加えて結晶化させ、さらに結晶をジイソプロピルエーテルで洗浄して黄色粉末の標記化合物を 0.24 g (収率 50%) 得た。

[0380] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

2.03-2.11 (2H, m)、2.49 (2H, t)、2.74 (2H, t)、3.70 (3H, s)、7.24 (1H, t)、7.36 (1H, d)、7.58-7.62 (1H, m)、7.77 (1H, s)、16.6 (1H, s)

実施例 2

[0381] 3-(2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル)-1-メチル-1, 8-ナフチリジン-2(1H)-オン(本発明の化合物番号 I I-2)の製造

[0382] (1) 3-オキソ-1-シクロヘキセニル 1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレートの製造

1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸 1.0 g (4.9 mmol) をジクロロメタン (50 mL) に溶解し、塩化オキザリル 1.0 mL (12 mmol) を加えた。この混合物に N, N-ジメチルホルムアミド 3 滴を加えて 40°C で 1 時間攪拌した。反応溶液を減圧下濃縮し、1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸クロリドを得た。得られた酸クロリドをアセトニトリル (30 mL) に溶解し、この溶液を 1, 3-シクロヘキサジオン 0.60 g (5.4 mmol) とトリエチルアミン 0.82 mL (5.9 mmol) のアセトニトリル (50 mL) 溶液に氷冷下で添加し、室温で 1 時間攪拌した。反応混合物を、水にあげ、酢酸エチルで抽出し、有機相を水、炭酸水素ナトリウム水溶液、水の順で洗浄後、乾燥、濃縮した。残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄して微黄色固体の標記化合物を 0.83 g 得た (収率 57%)。

[0383] ¹H-NMR データ (CDCl₃/TMS δ (ppm)) :
2.09-2.18 (2H, m)、2.47 (2H, t)、2.73 (2H, t)、3.89 (3H, s)、6.05 (1H, s)、7.25-7.29 (1H, m)、8.03 (1H, dd)、8.49 (1H, s)、8.75 (1H, dd)

[0384] (2) 3-(2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル)-1-メチル-1, 8-ナフチリジン-2(1H)-オンの製造

3-オキソ-1-シクロヘキセニル 1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレート 0.83 g (2.8 mmol) をアセトニトリル (50 mL) に溶解した。この溶液にトリエチルアミン 0.43 mL (3.1 mmol) とアセトンシアノヒドリン 0.

2.6 g (3.1 mmol) を加え、室温で一昼夜撹拌した。反応混合物を飽和重曹水にあげ、酢酸エチルで洗浄し、水相にクエン酸を加えて pH 3~4 としてから酢酸エチルで抽出した。有機相を水洗、乾燥、濃縮し、残渣をカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：n-ヘキサン=1：1~1：0）で精製し淡黄色粉末の標記化合物を 0.30 g 得た（収率 36%）。

[0385] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

2.03-2.12 (2H, m)、2.49 (2H, t)、2.75 (2H, t)、3.92 (3H, s)、7.17-7.21 (1H, m)、7.69 (1H, s)、7.91 (1H, dd)、8.63 (1H, dd)、16.5 (1H, s)

実施例 3

[0386] 1-（エチルチオメチル）-3-（2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル）-1, 8-ナフチリジン-2（1H）-オン（本発明の化合物番号 II-19）の製造

[0387] （1）3-オキソ-1-シクロヘキセニル 1-（エチルチオメチル）-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレート

1-（エチルチオメチル）-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸 2.20 g (8.3 mmol) をジクロロメタン (80 mL) に溶解し、塩化オキザリル 5.0 mL (60 mmol) を加えた。この混合物に N,N-ジメチルホルムアミド 1 滴を加えて室温で 1 時間撹拌した。反応溶液を減圧下濃縮し、1-（エチルチオメチル）-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸クロリドを得た。得られた酸クロリドをジクロロメタン (80 mL) に溶解し、この溶液に 1, 3-シクロヘキサジオン 1.02 g (9.1 mmol) とトリエチルアミン 1.40 mL (10.0 mmol) を氷冷下で添加し、室温で 2 時間撹拌した。反応混合物を、炭酸水素ナトリウム水溶液にあげ、ジクロロメタンで抽出し、有機相を乾燥、濃縮した。残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄して微黄色固体の標記化合物を 2.99 g 得た（収率 定量的）。

[0388] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

1. 32 (3H, t)、2. 10-2. 16 (2H, m)、2. 47 (2H, t)、2. 72 (2H, t)、2. 84 (2H, q)、5. 68 (2H, s)、6. 04 (1H, s)、7. 28-7. 31 (1H, m)、8. 03 (1H, d)、8. 50 (1H, s)、8. 75 (1H, d)

[0389] (2) 1-(エチルチオメチル)-3-(2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル)-1, 8-ナフチリジン-2(1H)-オンの製造

3-オキソ-1-シクロヘキセニル 1-(エチルチオメチル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレート 2. 97 g (8. 3 mmol) をジクロロメタン (80 mL) に溶解した。この溶液にトリエチルアミン 1. 40 mL (10. 0 mmol) とアセトンシアニドリン 0. 77 g (9. 1 mmol) を加え、室温で一晩撹拌した。反応混合物をクエン酸水溶液にあげ、ジクロロメタンで抽出し、有機相を水洗、乾燥、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 4) で精製し、淡橙色結晶の標記化合物を 0. 77 g 得た (収率 26%)。

[0390] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

1. 29 (3H, t)、2. 05-2. 12 (2H, m)、2. 47 (2H, t)、2. 73-2. 82 (4H, m)、5. 63 (2H, s)、7. 19-7. 24 (1H, m)、7. 69 (1H, s)、7. 91 (1H, d)、8. 65 (1H, d)、16. 43 (1H, s)

実施例 4

[0391] 1-ベンジル-3-(2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル)-1, 8-ナフチリジン-2(1H)-オン (本発明の化合物番号 II-24) の製造

[0392] (1) 3-オキソ-1-シクロヘキセニル 1-ベンジル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレートの製造

1-ベンジル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸 1. 61 g (5. 7 mmol) をジクロロメタン (60 mL) に溶解し、塩化オキザリル 3. 5 mL (42 mmol) を加えた。この混合物に N, N-ジメチルホルムアミド 1 滴を加えて 40°C で 1 時間撹拌した

。反応溶液を減圧下濃縮し、1-ベンジル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸クロリドを得た。得られた酸クロリドをジクロロメタン (60 mL) に溶解し、この溶液に1, 3-シクロヘキサジオン0. 71 g (6. 3 mmol) とトリエチルアミン0. 97 mL (6. 9 mmol) を添加し、室温で2時間攪拌した。反応混合物を炭酸水素ナトリウム水溶液にあげ、ジクロロメタンで抽出し、有機相を乾燥、濃縮した。残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄して微黄色固体の標記化合物を2. 13 g 得た (収率 定量的) 。

[0393] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

2. 10-2. 17 (2H, m)、2. 46 (2H, t)、2. 72 (2H, t)、5. 79 (2H, s)、6. 03 (1H, s)、7. 22-7. 30 (4H, m)、7. 51-7. 54 (2H, m)、8. 02 (1H, d)、8. 49 (1H, s)、8. 75 (1H, d)

[0394] (2) 1-ベンジル-3-(2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル)-1, 8-ナフチリジン-2 (1H)-オンの製造

3-オキソ-1-シクロヘキセニル 1-ベンジル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレート2. 13 g (5. 7 mmol) をジクロロメタン (60 mL) に溶解し、この溶液にトリエチルアミン0. 97 mL (6. 9 mmol) とアセトンシアニドリン0. 54 g (6. 3 mmol) を加え、室温で一昼夜攪拌した。反応混合物をクエン酸水溶液にあげ、ジクロロメタンで抽出し、有機相を水洗、乾燥、濃縮した。残渣をメタノールで洗浄して暗黄色結晶の標記化合物を1. 31 g 得た (収率62%) 。

[0395] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

2. 06-2. 09 (2H, m)、2. 49 (2H, t)、2. 74 (2H, t)、5. 73 (2H, s)、7. 16-7. 27 (4H, m)、7. 46 (1H, d)、7. 71 (1H, s)、7. 90 (1H, d)、8. 61 (1H, d)、16. 41 (1H, s)

実施例 5

[0396] 3-(2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル)-1-(2-メトキシベンジル)-1, 8-ナフチリジン-2 (1H)-オン (本発明の化合物番号 II-37) の製造

[0397] (1) 3-オキソ-1-シクロヘキセニル 1-(2-メトキシベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレートの製造

1-(2-メトキシベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸 3.83 g (12.3 mmol) をジクロロメタン (100 mL) に溶解し、塩化オキザリル 7.5 mL (89 mmol) を加えた。この混合物に N, N-ジメチルホルムアミド 1 滴を加えて 40°C で 1 時間攪拌した。反応溶液を減圧下濃縮し、1-(2-メトキシベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸クロリドを得た。得られた酸クロリドをジクロロメタン (100 mL) に溶解し、この溶液を 1, 3-シクロヘキサジオン 1.52 g (13.6 mmol) とトリエチルアミン 2.11 mL (14.8 mmol) のジクロロメタン (100 mL) 溶液に氷冷下で添加し、室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を、炭酸水素ナトリウム水溶液にあげ、ジクロロメタンで抽出し、有機相を乾燥、濃縮した。残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄して微黄色固体の標記化合物を 4.82 g 得た (収率 97%)。

[0398] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

2.06-2.14 (2H, m)、2.44 (2H, t)、2.71 (2H, t)、3.89 (3H, s)、5.80 (2H, s)、6.03 (1H, s)、6.60 (1H, d)、6.74 (1H, t)、6.88 (1H, d)、7.15-7.27 (2H, m)、8.05 (1H, d)、8.56 (1H, s)、8.66 (1H, s)

[0399] (2) 3-(2-ヒドロキシー-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル)-1-(2-メトキシベンジル)-1, 8-ナフチリジン-2 (1H)-オンの製造

3-オキソ-1-シクロヘキセニル 1-(2-メトキシベンジル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレート 4.82 g (11.9 mmol) をジクロロメタン (100 mL) に溶解し、この溶液にトリエチルアミン 2.01 mL (14.3 mmol) とアセトンシアンヒドリン 1.11 g (13.1 mmol) を加え、室温で一昼夜

撈拌した。反応混合物をクエン酸水溶液にあげ、ジクロロメタンで抽出し、有機相を水洗、乾燥、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：n-ヘキサン＝1：3～1：1）で精製し黄色結晶の標記化合物を1.59 g（収率33%）得た。

[0400] $^1\text{H-NMR}$ データ（ CDCl_3/TMS δ （ppm））：

2.00–2.08 (2H, m)、2.45 (2H, t)、2.71 (2H, t)、3.90 (3H, s)、5.73 (2H, s)、6.72–6.80 (1H, m)、6.87 (1H, d)、7.13–7.18 (2H, m)、7.80 (1H, s)、7.94 (1H, d)、8.54 (1H, d)、16.31 (1H, s)

実施例 6

[0401] 3-（2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル）-1-フェニル-1, 8-ナフチリジン-2（1H）-オン（本発明の化合物番号II-41）の製造

[0402] （1）3-オキソ-1-シクロヘキセニル 2-オキソ-1-フェニル-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレートの製造

2-オキソ-1-フェニル-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸1.62 g（6.1 mmol）をジクロロメタン（60 mL）に溶解し、塩化オキザリル3.7 mL（44 mmol）を加えた。この混合物にN, N-ジメチルホルムアミド1滴を加えて40℃で1時間撈拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、2-オキソ-1-フェニル-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸クロリドを得た。得られた酸クロリドをジクロロメタン（60 mL）に溶解し、この溶液に1, 3-シクロヘキサジオン0.75 g（6.7 mmol）とトリエチルアミン1.03 mL（7.3 mmol）を添加し、室温で2時間撈拌した。反応混合物を、炭酸水素ナトリウム水溶液にあげ、ジクロロメタンで抽出し、有機相を乾燥、濃縮した。残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄して微黄色固体の標記化合物を2.16 g（収率99%）得た。

[0403] $^1\text{H-NMR}$ データ（ CDCl_3/TMS δ （ppm））：

2.06–2.14 (2H, m)、2.45 (2H, t)、2.70 (2H, t)、6.04 (3H, s)、7.24–7.29 (3H, m)

)、7.49–7.62 (3H, m)、8.08 (1H, d)、8.57–8.60 (3H, m)

[0404] (2) 3-(2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル)-1-フェニル-1, 8-ナフチリジン-2 (1H)-オンの製造

3-オキソ-1-シクロヘキセニル 1-フェニル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレート 2.16 g (6.0 mmol) をジクロロメタン (50 mL) に溶解し、この溶液にトリエチルアミン 1.01 mL (7.2 mmol) とアセトンシアニドリン 0.56 g (6.6 mmol) を加え、室温で一昼夜攪拌した。反応混合物をクエン酸水溶液にあげ、ジクロロメタンで抽出し、有機相を水洗、乾燥、濃縮した。残渣をメタノールで洗浄して淡茶色結晶の標記化合物を 1.01 g (収率 47%) 得た。

[0405] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

1.99–2.05 (2H, m)、2.44 (2H, t)、2.70 (2H, t)、7.16–7.19 (1H, m)、7.31 (2H, d)、7.45–7.49 (1H, m)、7.56 (2H, t)、7.82 (1H, s)、7.95 (1H, d)、8.48 (1H, d)、16.38 (1H, s)

実施例 7

[0406] 3-(2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル)-1-(5-メチル-3-イソオキサゾリル)-1, 8-ナフチリジン-2 (1H)-オン (本発明の化合物番号 II-63) の製造

[0407] (1) 3-(2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル)-1-(5-メチル-3-イソオキサゾリル)-1, 8-ナフチリジン-2 (1H)-オンの製造

1-(5-メチル-3-イソオキサゾリル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸 1.7 g (6.3 mmol) をジクロロメタン (50 mL) に溶解し、塩化オキサリル 3.0 mL (36 mmol) を加えた。この混合物に N, N-ジメチルホルムアミド 1 滴を加えて室温で 1 時間攪拌した。反応溶液を減圧下濃縮し、1-(5-メチル-3-イソオキサゾリル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチ

リジン-3-カルボン酸クロリドを得た。得られた酸クロリドをジクロロメタン（50 mL）に溶解し、この溶液に氷冷下で1, 3-シクロヘキサジオン0.77 g（6.9 mmol）とトリエチルアミン1.1 mL（7.5 mmol）を添加し、氷冷下で30分攪拌した。この混合物にトリエチルアミン0.97 mL（6.9 mmol）とアセトンシアニドリン0.59 g（6.9 mmol）を加え、40℃で1時間攪拌した。反応混合物をクエン酸水溶液にあげ、ジクロロメタンで抽出し、有機相を水洗、乾燥、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：n-ヘキサン=1：1～9：1）で精製し、黄色結晶の標記化合物を0.27 g（収率12%）得た。

- [0408] $^1\text{H-NMR}$ データ（ CDCl_3/TMS δ （ppm））：
2.01-2.07 (2H, m)、2.46 (2H, t)、2.55 (1H, s)、2.72 (2H, t)、6.21 (1H, d)、7.22-7.26 (1H, m)、7.81 (1H, s)、7.96 (1H, d)、8.53 (1H, d)、16.31 (1H, s)

実施例 8

- [0409] 3-（2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル）-1-（6-メトキシ-3-ピリジニル）-1, 8-ナフチリジン-2（1H）-オン（本発明の化合物番号II-92）の製造

- [0410] （1）3-オキソ-1-シクロヘキセニル 1-（6-メトキシ-3-ピリジニル）-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレートの製造

1-（6-メトキシ-3-ピリジニル）-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸1.35 g（4.5 mmol）をジクロロメタン（50 mL）に溶解し、塩化オキザリル2.5 mL（30 mmol）を加えた。この混合物にN, N-ジメチルホルムアミド1滴を加えて室温で2時間攪拌した。反応溶液を減圧下濃縮し、1-（6-メトキシ-3-ピリジニル）-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸クロリドを得た。得られた酸クロリドをジクロロメタン（50 mL）に溶解し、この溶液に氷冷下で1, 3-シクロヘキサジオン0.

5.6 g (5.0 mmol) とトリエチルアミン 1.54 mL (10.8 mmol) を添加し、室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を、水にあげ、ジクロロメタンで抽出し、有機相を乾燥、濃縮した。残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄して微黄色固体の標記化合物を 1.78 g (収率 定量的) 得た。

[0411] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

2.07-2.16 (2H, m)、2.46 (2H, t)、2.70 (2H, t)、4.01 (3H, s)、6.05 (1H, s)、6.93 (1H, d)、7.29 (1H, dd)、7.51 (1H, dd)、8.07-8.11 (2H, m)、8.58-8.61 (2H, m)

[0412] (2) 3- (2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル) -1- (6-メトキシ-3-ピリジニル) -1, 8-ナフチリジン-2 (1H) -オンの製造

3-オキソ-1-シクロヘキセニル 1- (6-メトキシ-3-ピリジニル) -2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレート 1.78 g (4.5 mmol) をジクロロメタン (50 mL) に溶解し、この溶液にトリエチルアミン 0.77 mL (5.5 mmol) とアセトンシアンヒドリン 0.43 g (5.0 mmol) を加え、室温で一晩攪拌した。反応混合物をクエン酸水溶液にあげ、ジクロロメタンで抽出し、有機相を水洗、乾燥、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 1 ~ 7 : 3) で精製し橙色結晶の標記化合物を 0.37 g (収率 21%) 得た。

[0413] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

2.01-2.04 (2H, m)、2.44 (2H, t)、2.72 (2H, t)、3.99 (3H, s)、6.91 (1H, d)、7.20 (1H, dd)、7.54 (1H, dd)、7.81 (1H, s)、7.97 (1H, d)、8.14 (1H, d)、8.48 (1H, d)、16.36 (1H, s)

実施例 9

[0414] 1- (2, 3-ジヒドロベンゾ[b][1, 4]ジオキシ-6-イル) -3- (2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル) -1, 8-ナフチリジン-2 (1H) -オン (本発明の化合物番号 II-118) の製造

[0415] (1) 3-オキソ-1-シクロヘキセニル 1-(2, 3-ジヒドロベンゾ[b][1, 4]ジオキシン-6-イル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレートの製造

[0416] 1-(2, 3-ジヒドロベンゾ[b][1, 4]ジオキシン-6-イル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸 3.0 g (9.3 mmol) をジクロロメタン (70 mL) に溶解し、塩化オキザリル 3 mL (35 mmol) を加えた。この混合物に N, N-ジメチルホルムアミド 5 滴を加えて 40°C で 1 時間攪拌した。反応溶液を減圧下濃縮し、1-(2, 3-ジヒドロベンゾ[b][1, 4]ジオキシン-6-イル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸クロリドを得た。得られた酸クロリドをジクロロメタン (70 mL) に溶解し、この溶液を 1, 3-シクロヘキサジオン 1.14 g (10.1 mmol) とトリエチルアミン 1.55 mL (11.1 mmol) のジクロロメタン (70 mL) 溶液に氷冷下で添加し、室温で 1 時間攪拌した。反応混合物を水にあげジクロロメタンで抽出し、有機相を炭酸水素ナトリウム水溶液、水の順で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄して微黄色固体の標記化合物を 3.32 g (収率 86%) 得た。

[0417] ¹H-NMR データ (CDCl₃/TMS δ (ppm)) :
2.05-2.14 (2H, m)、2.45 (2H, t)、2.70 (2H, t)、4.31 (4H, s)、6.04 (1H, s)、6.73 (1H, dd)、6.80 (1H, d)、7.23-7.28 (1H, m)、8.06 (1H, dd)、8.57 (1H, s)、8.63 (1H, dd)

[0418] (2) 1-(2, 3-ジヒドロベンゾ[b][1, 4]ジオキシン-6-イル)-3-(2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル)-1, 8-ナフチリジン-2 (1H)-オンの製造

3-オキソ-1-シクロヘキセニル 1-(2, 3-ジヒドロベンゾ[b][1, 4]ジオキシン-6-イル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレート 3.32 g (7.9 mmol) をアセトニトリル (150 mL) に溶解し、この溶液にトリエチルアミン 0.88

g (8.7 mmol) とアセトンシアノヒドリン 0.77 g (8.7 mmol) を加え、室温で一昼夜攪拌した。反応混合物を飽和重曹水にあげ、クロロホルムで洗浄し、水相にクエン酸を加えて pH 3~4 としてからクロロホルムで抽出した。有機相を水洗、乾燥、濃縮し、残渣をカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：n-ヘキサン=1：1~1：0）で精製し、淡橙色粉末の標記化合物を 0.90 g（収率 27%）得た。

[0419] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

1.98-2.06 (2H, m)、2.44 (2H, t)、2.70 (2H, t)、4.30 (4H, s)、6.77 (1H, dd)、7.01 (1H, d)、7.15-7.19 (1H, m)、7.80 (1H, s)、7.94 (1H, dd)、8.52 (1H, dd)、16.36 (1H, s)

実施例 10

[0420] 3-（2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル）-1-メチル-7-（トリフルオロメチル）-1,8-ナフチリジン-2（1H）-オン（本発明の化合物番号 II-136）の製造

[0421] （1）3-オキソ-1-シクロヘキセニル 1-メチル-2-オキソ-7-（トリフルオロメチル）-1,2-ジヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-カルボキシレートの製造

1-メチル-2-オキソ-7-（トリフルオロメチル）-1,2-ジヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-カルボン酸 0.83 g (3.0 mmol) をジクロロメタン (50 mL) に溶解し、塩化オキザリル 1.0 mL (12 mmol) を加えた。この混合物に N,N-ジメチルホルムアミド 2 滴を加えて 40°C で 2 時間攪拌した。反応溶液を減圧下濃縮し、1-メチル-2-オキソ-7-（トリフルオロメチル）-1,2-ジヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-カルボン酸クロリドを得た。得られた酸クロリドをアセトニトリル (30 mL) に溶解し、この溶液を 1,3-シクロヘキサジオン 0.38 g (3.4 mmol) とトリエチルアミン 0.51 mL (3.7 mmol) のアセトニトリル (50 mL) 溶液に氷冷下で添加し、室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を水にあげ、酢酸エチルで抽出し、有機相を水、炭酸水

素ナトリウム水溶液、水の順で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄して褐色結晶の標記化合物を0.51g（収率46%）得た。

[0422] $^1\text{H-NMR}$ データ（ CDCl_3/TMS δ （ppm））：

2.05-2.17(2H, m)、2.49(2H, t)、2.73(2H, t)、3.89(3H, s)、6.05(1H, s)、7.61(1H, d, $J=8.1\text{Hz}$)、8.22(1H, d, $J=8.0\text{Hz}$)、8.49(1H, s)

[0423] (2) 3-（2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセンカルボニル）-1-メチル-7-（トリフルオロメチル）-1,8-ナフチリジン-2（1H）-オンの製造

3-オキソ-1-シクロヘキセニル 1-メチル-2-オキソ-7-（トリフルオロメチル）-1,8-ナフチリジン-3-カルボキシレート0.51g（1.4mmol）をアセトニトリル（50mL）に溶解し、この溶液にトリエチルアミン0.15g（1.5mmol）とアセトンシアノヒドリン0.14g（1.6mmol）を加え、室温で一昼夜攪拌した。反応混合物を飽和重曹水にあげ、酢酸エチルで洗浄し、水相にクエン酸を加えてpH3～4としてから酢酸エチルで抽出した。有機相を水洗、乾燥、濃縮し、残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄して微褐色結晶の標記化合物を0.17g（収率33%）得た。

[0424] $^1\text{H-NMR}$ データ（ CDCl_3/TMS δ （ppm））：

2.03-2.12(2H, m)、2.47H, t)、2.77(2H, t)、3.83(3H, s)、7.53(1H, d, $J=8.0\text{Hz}$)、7.73(1H, s)、8.06（1H, d, $J=7.7\text{Hz}$)、16.5(1H, s)

[0425] 上記実施例1～10で得られた化合物及びこれらの実施例と同様な方法で製造した本発明化合物の物性値を表67に示す。

[0426]

[表67]

化合物 番号	融点(°C)又は 屈折率(n_D^{20})
I-2	融点 179-181
I-56	融点 161-164
I-157	融点 178-181
II-2	融点 151-153
II-3	融点 140-142
II-4	融点 39-41
II-15	融点 112-114
II-19	融点 108-110
II-24	融点 190-192
II-28	融点 157-159
II-29	融点 148-151
II-30	融点 149-151
II-37	融点 147-150
II-38	融点 192-194
II-39	融点 125-127
II-41	融点 212-214
II-43	融点 229-231
II-48	融点 220-222
II-52	融点 163-164
II-54	融点 127-129
II-55	融点 257-259
II-56	融点 247-250
II-58	融点 183-186
II-63	融点 113-116
II-92	融点 220-222
II-118	融点 226-228
II-121	融点 176-179
II-123	融点 239-240
II-126	融点 66-67
II-128	融点 150-152
II-131	融点 192-194
II-133	融点 184-187
II-136	融点 194-196
II-138	融点 147-149
II-141	融点 144-145
II-143	融点 172-174
II-434	融点 116-118
II-442	融点 238-241
III-2	融点 177-179
III-41	融点 205-207
IV-41	融点 210-212
V-41	融点 207-208

[0427] [参考例 1]

(製造中間体) 1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸の製造 (製造中間体の化合物番号 V I I I - 1)

[0428] (1) ジエチル 2-(2-ニトロベンジリデン) マロネートの製造

2-ニトロベンズアルデヒド 32.3 g (0.21 mol) とマロン酸ジエチル 35.0 g (0.21 mol) とを室温下で無水酢酸 100 mL に加え、この混合物に炭酸水素ナトリウム 27.0 g (0.32 mol) を加えて 100°C で一晩反応させた。反応混合物をおよそ半分まで減圧濃縮し、この反応混合物に氷水を加えて酢酸エチルで抽出した。有機相を、炭酸水素ナトリウム水溶液、水の順に洗浄し、乾燥、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル: n-ヘキサン = 1:9 ~ 1:4) で精製し、微黄色結晶の標記化合物を 37.0 g (収率 59%) 得た。

[0429] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

1.02 (3H, t)、1.38 (3H, t)、4.08 (2H, q)、4.35 (2H, q)、7.43 (1H, d)、7.55–7.67 (2H, m)、8.20 (1H, s)、8.22 (1H, d)

[0430] (2) エチル 2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボキシレート の製造

ジエチル 2-(2-ニトロベンジリデン) マロネート 29.0 g (0.21 mol) を室温下で酢酸 100 mL に加え、80°C に加温した。この混合物に、鉄粉 37.0 g (0.66 mol) を徐々に加え、反応温度が 100°C まで上昇した。反応温度が下降した後、80°C で 5 時間反応させた。室温冷却後、酢酸エチルと水を加え、不溶物をろ過し、ろ液に炭酸水素ナトリウムを加えて中和した。析出した固体をろ別し、この固体を酢酸エチルに溶解させた。さらにろ液を酢酸エチルで抽出し、前記の溶液とあわせ、この溶液をクエン酸、水の順で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄して、淡黄色結晶の標記化合物を 13.6 g (収率 63%) 得た。

[0431] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

1. 46 (3H, t)、4. 46 (2H, q)、7. 26 (1H, t)、7. 51 (1H, d)、7. 59–7. 67 (2H, m)、8. 57 (1H, s)、12. 59 (1H, s)

[0432] (3) エチル 1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボキシレートの製造

エチル 2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボキシレート 3. 5 g (16 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド (80 mL) と 1, 2-ジメトキシエタン (25 mL) の混合溶媒に溶解し、窒素気流下、室温下で 60% 水素化ナトリウム (油性) 0. 71 g (18 mmol) を加え、室温で 15 分撹拌した。この混合物に、室温下で臭化リチウム 5. 6 g (64 mmol) を加え、室温で 15 分撹拌し、さらにヨードメタン 4. 6 g (32 mmol) を室温下に加え 60°C で 3 時間撹拌した。反応混合物をクエン酸水溶液に注ぎ、酢酸エチルで抽出し、有機相を食塩水、炭酸水素ナトリウム水溶液、食塩水の順で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル: n-ヘキサン = 1: 4 ~ 4: 1) で精製し、微黄色結晶の標記化合物を 2. 4 g (収率 64%) 得た。

[0433] ¹H-NMR データ (CDCl₃/TMS δ (ppm)) :

1. 42 (3H, t)、3. 75 (3H, s)、4. 43 (2H, q)、7. 27 (1H, t)、7. 37 (1H, d)、7. 64–7. 69 (2H, m)、8. 39 (1H, s)

[0434] (4) 1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸の製造

エチル 1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボキシレート 2. 4 g (10. 4 mmol) を 1, 4-ジオキサン (50 mL) に溶解し、この溶液に室温で水酸化リチウム一水和物 0. 65 g (15 mmol) と水 10 mL を加え、室温で 24 時間撹拌した。反応混合物を炭酸水素ナトリウム水溶液にあげ、酢酸エチルで洗浄し、水相をクエン酸で酸性にしてからクロロホルムで抽出した。有機相を水洗、乾燥、濃縮し、得られた残渣を酢酸エチルで洗浄して微黄色結晶の標記化合物を 2. 02 g (収率 96%) 得た。

[0435] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

3.88 (3H, s)、7.45 (1H, t)、7.53 (1H, d)、7.82 (1H, t)、8.93 (1H, s)、14.55 (1H, s)

[0436] [参考例2]

(製造中間体) 1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸の製造 (製造中間体の化合物番号 V I I I - 4)

(1) 3-ホルミル-2-(ピバロイルアミノ)ピリジンの製造

2-(ピバロイルアミノ)ピリジン 11.4 g (64 mmol) をテトラヒドロフラン 50 mL に溶解し、1.6 M ノルマルブチルリチウム 100 mL (0.16 mol) を -60°C で滴下し、さらに -10°C で 3 時間反応させた。この反応混合物に、 -60°C で、N, N-ジメチルホルムアミド 14 g (0.19 mol) を滴下し、反応液を室温で一晩攪拌した。反応混合物を氷にあげ、6 N-塩酸を加えて酸性にした後、炭酸カリウムを加えてアルカリ性にし酢酸エチルで抽出した。有機相を水で洗浄し、乾燥、濃縮し、得られた残渣をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 4 ~ 1 : 0) で精製し淡黄色液体の標記化合物を 6.57 g (収率 50%) 得た。

[0437] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

1.38 (9H, s)、7.19-7.22 (1H, m)、8.05 (1H, dd)、8.69 (1H, dd)、9.94 (1H, s)、10.90 (1H, br)

[0438] (2) エチル 2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレートの製造

3-ホルミル-2-(ピバロイルアミノ)ピリジン 6.57 g (32 mmol) をエタノール (50 mL) に溶解し、この溶液にマロン酸ジエチル 10.2 g (64 mmol) とピロリジン 1.6 mL (16 mmol) を加え 100°C で一晩攪拌した。反応混合物を室温冷却し、析出した固体をエタノールで洗浄して黄色固体の標記化合物を 2.2 g (収率 32%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

1. 44 (3H, t)、4. 45 (2H, q)、7. 26–7. 30 (1H, m)、8. 05 (1H, dd)、8. 47 (1H, s)、9. 93 (1H, dd)

[0439] (3) エチル 1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレートの製造

エチル 2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレート 2. 2 g (10 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド (50 mL) と 1, 2-ジメトキシエタン (15 mL) の混合溶媒に溶解し、窒素気流下、室温で 60% 水素化ナトリウム (油性) 0. 45 g (11 mmol) を加え、さらに室温で 30 分撹拌した。この混合物に、氷冷下、臭化リチウム 3. 5 g (40 mmol) を加え、室温で 30 分撹拌し、さらにヨードメタン 3. 9 g (27. 5 mmol) を室温下に加え、60℃で 6 時間撹拌した。反応混合物をクエン酸水溶液に注ぎ、酢酸エチルで抽出し、有機相を食塩水、炭酸水素ナトリウム水溶液、食塩水の順で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄して微紫色固体の標記化合物を 1. 66 g (収率 71%) 得た。

[0440] ¹H-NMR データ (CDCl₃/TMS δ (ppm)) :

1. 42 (3H, t)、3. 87 (3H, s)、4. 43 (2H, q)、7. 21–7. 25 (1H, m)、7. 97 (1H, dd)、8. 34 (1H, s)、8. 69 (1H, dd)

[0441] (4) 1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸の製造

エチル 1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレート 1. 66 g (7. 1 mmol) を 1, 4-ジオキサン (50 mL) に溶解し、室温で水酸化リチウム-水和物 0. 45 g (11 mmol) と水 10 mL を加え、室温で 1. 5 時間撹拌した。反応混合物を炭酸水素ナトリウム水溶液にあげ、酢酸エチルで洗浄した。水相をクエン酸で酸性にしてから酢酸エチルで抽出し、有機相を水洗、乾燥、濃縮した。残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄して無色結晶の標記化合物を 1. 30 g (収率 89%) 得た。

[0442] ^1H -NMRデータ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

3.99 (3H, s)、7.39–7.43 (1H, m)、8.16 (1H, dd)、7.83 (1H, dd)、8.92 (1H, s)、
14.34 (1H, s)

[0443] [参考例3]

(製造中間体) 1 – (エチルチオメチル) – 2 – オキソー 1, 2 – ジヒドロ – 1, 8 – ナフチリジン – 3 – カルボン酸の製造 (製造中間体の化合物番号 V I I I – 8)

(1) (2 – (メチルアミノ) – 3 – ピリジニル) メタノールの製造

2 – クロロニコチン酸 30.0 g (0.19 mol) を N, N – ジメチルホルムアミド (400 mL) に溶解し、メチルアミン塩酸塩 31.0 g (0.38 mol) と炭酸カリウム 105 g (0.76 mol)、臭化銅 (I) 2.73 g (19.0 mmol) を加え 100°C で 20 時間攪拌した。室温に冷却後、不溶物をろ過し、ろ液を濃縮した。得られた残渣に 10% 水酸化ナトリウム水溶液を加え、ジエチルエーテルで洗浄した。水相に濃塩酸を加えて pH 6 ~ 7 とし、水相を濃縮して得られた固体を乾燥して粗製の 2 – (メチルアミノ) ニコチン酸を得た。

[0444] 窒素気流下、氷冷下で水素化リチウムアルミニウム 14.4 g (0.38 mol) をテトラヒドロフラン (300 mL) に加え、この混合物に粗製の 2 – (メチルアミノ) ニコチン酸のテトラヒドロフラン (100 mL) 溶液を滴下し、室温下で一晩攪拌した。反応混合物に、酢酸エチルを加え、さらに 10% 水酸化ナトリウム水溶液 152 mL を加え、不溶物をろ過した。ろ液を濃縮し、残渣をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : n – ヘキサン = 1 : 1 ~ 4 : 1) で精製し、淡黄色粘稠体の標記化合物を 9.10 g (収率 35%) 得た。

[0445] ^1H -NMRデータ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

2.10 (1H, s)、3.01 (3H, d)、4.59 (2H, s)、5.38 (1H, s)、6.48–6.52 (1H, m)、7.21 (1H, d)、8.01 (1H, d)

[0446] (2) 2 – (メチルアミノ) ニコチンアルデヒドの製造

(2-(メチルアミノ)-3-ピリジニル)メタノール 9.10 g (66.0 mmol) をクロロホルム (70 mL) に溶解し、二酸化マンガン 17.4 g (200 mmol) を加えて 60°C で一晩撹拌した。反応混合物をろ過し、ろ液を濃縮して橙色固体の標記化合物を 8.66 g (収率 96%) 得た。

[0447] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

3.10 (3H, d)、6.62-6.66 (1H, m)、7.74 (1H, d)、8.36 (1H, d)、9.80 (1H, s)

[0448] (3) メチル 1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレートの製造

2-(メチルアミノ)ニコチンアルデヒド 8.66 g (64.5 mmol) をメタノール (100 mL) に溶解し、マロン酸ジメチル 12.68 g (96.0 mmol) とピペリジン 2.18 g (25.6 mmol) を加え 80°C で 7 時間撹拌した。冷却して析出した固体をろ別し、ジイソプロピルエーテルで洗浄して淡黄色固体の標記化合物を 11.71 g (収率 84%) 得た。

[0449] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

3.87 (3H, s)、3.97 (3H, s)、7.21-7.27 (1H, m)、7.98 (1H, d)、8.39 (1H, s)、8.70 (1H, d)

[0450] (4) メチル 1-(ブロモメチル)-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレートの製造

メチル 1-メチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレート 10.71 g (49.0 mmol) を四塩化炭素 (200 mL) に溶解し、N-ブromoこはく酸イミド 8.64 g (49.0 mmol) と 1, 2-アゾビス (2-メチルプロピオニトリル) 0.1 g を加えて、光を照射しながら 4 時間撹拌した。さらに、N-ブromoこはく酸イミド 3.0 g (17.0 mmol) を加え、光を照射しながら 3 時間撹拌した。反応混合物を水にあげ、クロロホルムで抽出し、有機相を水洗、乾燥、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : クロロホルム

= 1 : 19) で精製し無色結晶の標記化合物を 10.56 g (収率 73%) 得た。

[0451] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

3.98 (3H, s)、6.36 (2H, d, $J=85.3\text{Hz}$)、7.32–7.35 (1H, m)、8.02 (1H, d)、8.46 (1H, s)、8.78 (1H, d)

[0452] (5) メチル 1-(エチルチオメチル)-2-オキソー1,2-ジヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-カルボキシレートの製造

メチル 1-(ブロモメチル)-2-オキソー1,2-ジヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-カルボキシレート 3.00 g (10.1 mmol) を N,N -ジメチルホルムアミド (40 mL) に溶解し、エタントール 0.94 g (15.1 mmol) と炭酸カリウム 2.09 g (15.1 mmol) を加えて、室温で一晩攪拌した。反応混合物を水にあげ、酢酸エチルで抽出し、有機相を水洗、乾燥、濃縮して、淡黄色結晶の標記化合物を 2.85 g (収率 定量的) 得た。

[0453] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

1.31 (3H, t)、2.84 (2H, q)、3.97 (3H, s)、5.68 (2H, s)、7.23–7.28 (1H, m)、7.99 (1H, d)、8.41 (1H, s)、8.71 (1H, d)

[0454] (6) 1-(エチルチオメチル)-2-オキソー1,2-ジヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-カルボン酸の製造

メチル 1-(エチルチオメチル)-2-オキソー1,2-ジヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-カルボキシレート 2.81 g (10.1 mmol) を 1,4-ジオキサン (70 mL) に溶解し、室温で 6 N 塩酸 (20 mL) を加え、50°C で 3 時間攪拌した。反応混合物の溶媒を減圧留去し、得られた残渣を水、ジイソプロピルエーテルで順次洗浄し、淡黄色結晶の標記化合物を 2.20 g 得た (収率 82%)。

[0455] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

1.33 (3H, t)、2.71 (2H, q)、5.77 (2H, s)、7.41–7.45 (1H, m)、8.18 (1H, d)、8.84 (1H, d)、8.92 (1H, s)、14.06 (1H, s)

[0456] [参考例 4]

(製造中間体) 1-ベンジル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸の製造 (製造中間体の化合物番号 V I I I - 9)

(1) エチル 1-ベンジル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレートの製造

エチル 2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレート 1. 50 g (6. 9 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド (30 mL) に溶解し、炭酸カリウム 1. 43 g (10. 4 mmol) と臭化ベンジル 1. 36 g (7. 9 mmol) を加え、室温で一昼夜撹拌した。反応混合物を水に注ぎ、ジエチルエーテルで抽出し、有機相を乾燥、ろ過、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : n - ヘキサン = 3 : 7 ~ 1 : 1) で精製し、無色結晶の標記化合物を 1. 95 g (収率 92%) 得た。

[0457] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

1. 41 (3H, t)、4. 42 (2H, q)、5. 78 (2H, s)、7. 18-7. 28 (4H, m)、7. 52 (2H, d)、7. 96 (1H, d)、6. 35 (1H, s)、8. 69 (1H, s)

[0458] (2) 1-ベンジル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸の製造

エチル 1-ベンジル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレート 1. 95 g (6. 3 mmol) を 1, 4-ジオキサン (30 mL) に溶解し、この溶液に室温で炭酸カリウム 1. 31 g (9. 5 mmol) と水 60 mL を加え、50°C で 3 時間撹拌した。反応混合物の溶媒を減圧留去し、残渣を水に溶解し、濃塩酸を加え酸性とし、クロロホルムで抽出した。有機相を乾燥、ろ過、濃縮し、無色結晶の標記化合物を 1. 71 g (収率 97%) 得た。

[0459] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

5. 88 (2H, s)、7. 26-7. 33 (3H, m)、7. 39-7. 43 (1H, m)、7. 51 (2H, d)、8. 16 (1H, d)

)、8.85(1H, d)、8.91(1H, s)、14.27(1H, s)

[0460] [参考例5]

(製造中間体) 1-(2-メトキシベンジル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-カルボン酸の製造 (製造中間体の化合物番号 V I I I - 2 0)

(1) 2-(2-メトキシベンジルアミノ)ニコチン酸の製造

2-クロロニコチン酸 7.00 g (44.2 mmol) と 2-メトキシベンジルアミン 12.13 g (88.4 mmol) を 140°C で 4 時間加熱した。室温に放冷後、反応混合物に 10% 水酸化ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで洗浄した。水相に濃塩酸を加えて pH 6~7 とし、析出した個体をろ別、乾燥し、淡黄色粉末の標記化合物を 8.50 g (収率 74%) 得た。

[0461] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

3.87(3H, s)、4.78(2H, s)、6.52-6.56(1H, m)、6.87-6.92(2H, m)、7.23-7.33(2H, m)、8.18(1H, d)、8.33(1H, d)、8.34(1H, s)

[0462] (2) (2-(2-メトキシベンジルアミノ)-3-ピリジニル)メタノールの製造

窒素気流下、氷冷下で水素化リチウムアルミニウム 2.50 g (65.8 mmol) をテトラヒドロフラン (100 mL) に加え、この溶液に 2-(2-メトキシベンジルアミノ)ニコチン酸 8.50 g (32.9 mmol) のテトラヒドロフラン (70 mL) 溶液を滴下し、室温下で 1 時間攪拌した。反応混合物に酢酸エチルを加え、次に 10% 水酸化ナトリウム水溶液 26.4 mL を加え、不溶物をろ過した。ろ液を濃縮し、得られた残渣を酢酸エチルに溶解し、乾燥、ろ過、濃縮して、淡黄色粘稠体の標記化合物を 8.18 g (収率 定量的) 得た。

[0463] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

7.96(1H, br)、3.85(3H, s)、4.56(2H, s)、4.68(2H, d)、5.80(1H, s)、6.47-6.51(1H, m)、6.86-6.92(2H, m)、7.20-7.26(2H, m)、7.33(1H, d)、8.08(1H, d)

[0464] (3) 2-(2-メトキシベンジルアミノ)ニコチンアルデヒドの製造

(2-(2-メトキシベンジルアミノ)-3-ピリジニル)メタノール 8.03 g (32.9 mmol) をクロロホルム (100 mL) に溶解し、二酸化マンガン 8.60 g (98.7 mmol) を加えて 60°C で一晩撹拌した。反応混合物をろ過し、ろ液を濃縮して橙色固体の標記化合物を 7.40 g (収率 93%) 得た。

[0465] ¹H-NMR データ (CDCl₃/TMS δ (ppm)) :

3.90 (3H, s)、4.80 (2H, d)、6.59-6.64 (1H, m)、6.88-6.92 (2H, m)、7.22-7.33 (2H, m)、7.72 (1H, d)、8.33 (1H, d)、8.83 (1H, s)、9.80 (1H, s)

[0466] (4) エチル 1-(2-メトキシベンジル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-カルボキシレートの製造

2-(2-メトキシベンジルアミノ)ニコチンアルデヒド 7.40 g (30.5 mmol) をエタノール (100 mL) に溶解し、マロン酸ジエチル 7.34 g (45.8 mmol) とピペリジン 0.95 g (10.0 mmol) を加え 100°C で 48 時間撹拌した。冷却して析出した固体を濾別し、ヘキサンで洗浄して淡黄色固体の標記化合物を 7.71 g (収率 75%) 得た。

[0467] ¹H-NMR データ (CDCl₃/TMS δ (ppm)) :

1.41 (3H, t)、3.90 (3H, s)、4.42 (2H, q)、5.79 (2H, s)、6.59 (1H, d)、6.73 (1H, t)、6.88 (1H, d)、7.14-7.22 (2H, m)、8.00 (1H, d)、8.61 (1H, d)

[0468] (5) 1-(2-メトキシベンジル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-カルボン酸の製造

エチル 1-(2-メトキシベンジル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-カルボキシレート 3.00 g (8.90 mmol) を 1,4-ジオキサン (90 mL) に溶解し、室温で 6 N 塩酸 (16 mL) を加えた。50°C で 5 時間撹拌した後、反応混合物から溶媒を減圧留去した。残渣を水で洗浄、乾燥して無色結晶の標記化合物を 2.80 g (収率 定量的) 得た。

[0469] ^1H -NMRデータ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

3.91 (3H, s)、5.90 (2H, s)、6.57 (1H, d)、6.78 (1H, t)、6.93 (1H, d)、7.21–7.30 (1H, m)、7.37–7.41 (1H, m)、8.19 (1H, d)、8.77 (1H, d)、8.98 (1H, s)、14.24 (1H, s)

[0470] [参考例6]

(製造中間体) 2-オキソ-1-フェニル-1,2-ジヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-カルボン酸の製造 (製造中間体の化合物番号 V I I I - 16)

(1) 2-(フェニルアミノ)ニコチン酸の製造

2-クロロニコチン酸 5.0 g (31.7 mmol) とアニリン 5.9 g (63.5 mmol)、ヨウ化カリウム 0.1 g を 140°C まで加熱し、この反応混合物にトルエン (30 mL) を加え 100°C で 2 時間撹拌した。反応混合物を冷却後、溶媒を留去し、残渣にクロロホルムを加え不溶物をろ過した。ろ液を濃縮して粗製の淡黄色結晶の標記化合物を 7.5 g 得た (収率 定量的)。

[0471] ^1H -NMRデータ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

6.76–6.79 (1H, m)、7.09 (1H, t)、7.35 (2H, t)、7.59 (2H, d)、8.33–8.39 (2H, m)、10.27 (1H, s)、10.59 (1H, s)

[0472] (2) (2-フェニルアミノ-3-ピリジニル)メタノールの製造

窒素気流下、氷冷下で水素化リチウムアルミニウム 2.41 g (63.4 mmol) をテトラヒドロフラン (80 mL) に加え、この溶液に 2-(フェニルアミノ)ニコチン酸 6.79 g (31.7 mmol) のテトラヒドロフラン (30 mL) 溶液を滴下し、室温下で 2 時間撹拌した。反応混合物に、酢酸エチルを加え、さらに 10% 水酸化ナトリウム水溶液 25 mL を加え、不溶物をろ過した。ろ液を濃縮し、得られた残渣を酢酸エチルに溶解し、乾燥、ろ過、濃縮して黄色粘稠体の標記化合物を 6.9 g 得た (収率 定量的)。

[0473] ^1H -NMRデータ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

1. 89 (1H, s)、4. 70 (2H, s)、6. 69–6. 73 (1H, m)、6. 99 (1H, t)、7. 29–7. 37 (3H, m)、7. 56 (2H, d)、7. 68 (1H, s)、8. 19 (1H, d)

[0474] (3) 2-(フェニルアミノ)ニコチンアルデヒドの製造

(2-フェニルアミノ-3-ピリジニル)メタノール6. 35 g (31. 7 mmol) をクロロホルム (100 mL) に溶解し、二酸化マンガン8. 27 g (95. 1 mmol) を加えて60℃で7時間攪拌した。反応混合物をろ過し、ろ液を濃縮して橙色固体の標記化合物を6. 58 g 得た (収率定量的)

$^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

6. 82–6. 86 (1H, m)、7. 10 (1H, t)、7. 34–7. 39 (2H, m)、7. 74 (2H, d)、7. 86 (1H, d)、8. 42 (1H, d)、9. 88 (1H, s)、10. 45 (1H, s)

[0475] (4) エチル 2-オキソ-1-フェニル-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレートの製造

2-(フェニルアミノ)ニコチンアルデヒド6. 28 g (31. 7 mmol) をエタノール (150 mL) に溶解し、マロン酸ジエチル7. 62 g (47. 6 mmol) とピペリジン1. 35 g (15. 9 mmol) を加え100℃で一晩攪拌した。反応混合物を冷却して析出した固体を濾別し、エタノール、ジイソプロピルエーテルで順次洗浄して淡黄色固体の標記化合物を7. 42 g 得た (収率80%)。

[0476] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

1. 40 (3H, t)、4. 42 (2H, q)、7. 19–7. 22 (1H, m)、7. 26–7. 28 (2H, m)、7. 47–7. 51 (1H, m)、7. 54–7. 59 (2H, m)、8. 02 (1H, d)、8. 44 (1H, s)、8. 53 (1H, d)

[0477] (5) 2-オキソ-1-フェニル-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸の製造

エチル 2-オキソ-1-フェニル-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレート2. 00 g (6. 8 mmol) を1, 4-ジオキサン (100 mL) に溶解し、室温で炭酸カリウム1. 41 g (10. 2 mmol) と水200 mLを加え、50℃で3時間攪拌した。反応混合物

から溶媒を減圧留去し、残渣を水に溶解し、そこへ濃塩酸を加え酸性とした。析出した個体をろ別、乾燥して淡黄色結晶の標記化合物を 1.72 g 得た（収率 95%）。

[0478] $^1\text{H-NMR}$ データ（ CDCl_3/TMS δ (ppm)）：

7.30–7.32 (2H, m)、7.38–7.41 (1H, m)、7.57–7.67 (3H, m)、8.23 (1H, d)、8.67 (1H, d)、9.05 (1H, s)、13.91 (1H, s)

[0479] [参考例 7]

（製造中間体）1-（5-メチルー3-イソオキサゾリル）-2-オキソ-1,2-ジヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-カルボン酸の製造（製造中間体の化合物番号 V I I I - 24）

（1）メチル 2-（トリフルオロメチルスルホニルオキシ）ニコチネートの製造

メチル 2-ヒドロキシニコチネート 10.3 g（70 mmol）をジクロロメタン 300 mL に溶解し、トリエチルアミン 7.8 g（77 mmol）を加え、この混合物に、無水トリフルオロメタンスルホン酸 20.9 g（74 mmol）を -60°C で滴下し、さらに -60°C で 30 分反応させた。反応混合物を水にあげジクロロメタンで抽出し、有機相を水で洗浄後、乾燥、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：*n*-ヘキサン = 1：4）で精製し淡黄色液体の標記化合物を 12.8 g 得た（収率 67%）。

[0480] $^1\text{H-NMR}$ データ（ CDCl_3/TMS δ (ppm)）：

4.00 (3H, s)、7.49–7.53 (1H, m)、8.49 (1H, dd)、8.54 (1H, dd)

[0481] （2）メチル 2-（5-メチルー3-イソオキサゾリル）アミノニコチネートの製造

メチル 2-（トリフルオロメチルスルホニルオキシ）ニコチネート 6.7 g（24 mmol）と 3-アミノ-5-メチルイソオキサゾール 3.0 g（31 mmol）をトルエン（100 mL）に溶解し、炭酸セシウム 13.1 g（40 mmol）、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（

0) 1. 5 g (1. 6 mmol)、4, 5-ビス(ジフェニルホスフィノ)-9, 9-ジメチルキサンテン 1. 9 g (3. 4 mmol) を加え 80°C で 1 時間加熱撹拌した。反応混合物を冷却後、溶媒を留去し残渣をカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル: n-ヘキサン=1: 4) で精製し、橙色粘稠体の標記化合物を 4. 3 g 得た(収率 78%)。

[0482] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

2. 42 (3H, s)、3. 94 (3H, s)、6. 81-6. 86 (2H, m)、8. 26 (1H, d)、8. 41 (1H, d)、10. 46 (1H, dd)

[0483] (3) (2-(5-メチル-3-イソオキサゾリル) アミノ-3-ピリジニル) メタノールの製造

窒素気流下、氷冷下で水素化リチウムアルミニウム 0. 75 g (20 mmol) をテトラヒドロフラン (70 mL) に加え、この溶液にメチル 2-(5-メチル-3-イソオキサゾリル) アミノニコチネート 2. 3 g (9. 9 mmol) のテトラヒドロフラン (30 mL) 溶液を滴下し、氷冷下で 1 時間撹拌した。反応混合物に、酢酸エチルを加えて、さらに 10% 水酸化ナトリウム水溶液 8. 0 mL を加え、不溶物をろ過した。ろ液を濃縮し、残渣を酢酸エチルに溶解し、乾燥、ろ過、濃縮して濃縮して橙色粘稠体標記化合物を 2. 2 g 得た(収率 定量的)。

[0484] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

2. 37 (1H, br)、2. 41 (3H, s)、4. 74 (2H, s)、6. 77-6. 82 (2H, m)、7. 41 (1H, d)、8. 21 (1H, d)、8. 27 (1H, s)

[0485] (4) (2-(5-メチル-3-イソオキサゾリル) アミノ) ニコチンアルデヒドの製造

(2-(5-メチル-3-イソオキサゾリル) アミノ-3-ピリジニル) メタノール 3. 3 g (16 mmol) をクロロホルム (60 mL) に溶解し、二酸化マンガンを 4. 3 g (49 mmol) を加えて 60°C で 48 時間撹拌した。反応混合物をろ過し、ろ液を濃縮して橙色粘稠体の標記化合物を 3. 3 g 得た(収率 定量的)。

[0486] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

2.43 (3H, s)、6.90 (1H, s)、6.95–7.00 (1H, m)、7.94 (1H, d)、8.46 (1H, d)、9.92 (1H, s)、10.68 (1H, s)

[0487] (5) エチル 1 – (5 – メチル – 3 – イソオキサゾリル) – 2 – オキソ – 1, 2 – ジヒドロ – 1, 8 – ナフチリジン – 3 – カルボキシレート の製造

(2 – (5 – メチル – 3 – イソオキサゾリル) アミノ) ニコチンアルデヒド 3.3 g (16 mmol) をエタノール (60 mL) に溶解し、マロン酸ジエチル 3.9 g (24 mmol) とピペリジン 0.56 g (6.5 mmol) を加え 90°C で一晩攪拌した。反応混合物を冷却後、溶媒を留去し、残渣をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : n - ヘキサン = 1 : 4 ~ 7 : 3) で精製し、淡黄色結晶の標記化合物を 2.7 g 得た (収率 55%)。

[0488] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

1.40 (3H, t)、2.57 (3H, s)、4.42 (2H, q)、6.19 (1H, s)、7.25–7.29 (1H, m)、8.03 (1H, d)、8.50 (1H, s)、8.58 (1H, d)

[0489] (6) 1 – (5 – メチル – 3 – イソオキサゾリル) – 2 – オキソ – 1, 2 – ジヒドロ – 1, 8 – ナフチリジン – 3 – カルボン酸 の製造

エチル 1 – (5 – メチル – 3 – イソオキサゾリル) – 2 – オキソ – 1, 2 – ジヒドロ – 1, 8 – ナフチリジン – 3 – カルボキシレート 1.8 g (6.0 mmol) を酢酸 (50 mL) に溶解し、この溶液に室温で 6 N 塩酸 (10 mL) を加え、さらに 60°C で 5 時間攪拌した。反応混合物から、溶媒を留去し、残渣をトルエンに溶解し、溶媒を減圧留去して無色結晶の標記化合物を 1.7 g 得た (収率 定量的)。

[0490] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

2.62 (3H, s)、6.24 (1H, s)、7.43–7.47 (1H, d)、8.23 (1H, d)、8.71 (1H, d)、9.04 (1H, s)、13.32 (1H, br)

[0491] [参考例 8]

(製造中間体) 1 – (6 – メトキシ – 3 – ピリジニル) – 2 – オキソ – 1, 2 – ジヒドロ – 1, 8 – ナフチリジン – 3 – カルボン酸 の製造 (製造中間体

の化合物番号V I I I - 2 5)

(1) メチル 2-クロロニコチネートの製造

2-クロロニコチン酸 15.0 g (95.2 mmol) をジクロロメタン (150 mL) に溶解し、塩化オキザリル 8.37 mL (94.5 mmol) を加えた、この混合物にN, N-ジメチルホルムアミド 6 滴を加えて室温で3時間攪拌した。この反応混合物に氷冷下、トリエチルアミン 40.1 mL (286 mmol) とメタノール 37 mL (914 mmol) を順次滴下して、氷冷下で30分攪拌した。反応混合物から溶媒を減圧留去後、残渣に炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、ジエチルエーテルで抽出した。有機相を水洗、乾燥、濃縮し、残渣をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : n - ヘキサン = 1 : 4) で精製し、淡黄色液体の標記化合物を 13.9 g 得た (収率 86%)。

[0492] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

3.97 (3H, s)、7.33 (1H, dd)、8.17 (1H, dd)、8.53 (1H, dd)

[0493] (2) メチル 2-(6-メトキシ-3-ピリジニル) アミノニコチネートの製造

メチル 2-クロロニコチネート 5.0 g (29 mmol) と 6-メトキシピリジン-3-アミン 4.3 g (35 mmol) をトルエン (80 mL) に溶解し、炭酸セシウム 16.1 g (50 mmol)、トリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム (0) 1.3 g (1.5 mmol)、4,5-ビス (ジフェニルホスフィノ) -9,9-ジメチルキサンテン 1.8 g (3.1 mmol) を加え 90°C で 72 時間加熱攪拌した。反応混合物から、溶媒を留去し、水と酢酸エチルを加えてろ過した。ろ液を酢酸エチルで抽出し、有機相を乾燥、濃縮し、残渣をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : n - ヘキサン = 1 : 4 ~ 1 : 1) で精製し淡黄色粘稠体の標記化合物を 6.8 g 得た (収率 96%)。

[0494] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

3.94 (6H, s)、6.68-6.77 (2H, m)、7.94 (1H, dd)、8.22 (1H, dd)、8.31 (1H, dd)

、8.36(1H, d)、9.88(1H, s)

[0495] (3) (2-(6-メトキシ-3-ピリジニル)アミノ-3-ピリジニル)メタノールの製造

窒素気流下、氷冷下で水素化リチウムアルミニウム2.1 g (56 mmol) をテトラヒドロフラン(100 mL)に加え、この溶液にメチル 2-(6-メトキシ-3-ピリジニル)アミノニコチネート6.8 g (28 mmol) のテトラヒドロフラン(60 mL)溶液を滴下し、室温下で2時間攪拌した。反応混合物に、酢酸エチルを加えて、さらに10%水酸化ナトリウム水溶液23 mLを加え、不溶物をろ過した。ろ液を濃縮し、残渣を酢酸エチルに溶解し、乾燥、ろ過、濃縮して黄色粘稠体の標記化合物を6.6 g 得た(収率 定量的)。

[0496] $^1\text{H-NMR}$ データ(CDCl_3/TMS δ (ppm)):

1.67(1H, br)、3.92(3H, s)、4.72(2H, s)、6.66-6.75(2H, m)、7.33(1H, dd)、7.51(1H, s)、7.91(1H, dd)、8.10(1H, dd)、8.21(1H, d)

[0497] (4) 2-(6-メトキシ-3-ピリジニルアミノ)ニコチンアルデヒドの製造

(2-(6-メトキシ-3-ピリジニル)アミノ-3-ピリジニル)メタノール6.48 g (28 mmol) をクロロホルム(200 mL)に溶解し、二酸化マンガンを7.3 g (84 mmol)を加えて50°Cで48時間攪拌した。反応混合物をろ過し、ろ液を濃縮して橙色固体の標記化合物を6.5 g 得た(収率 定量的)。

[0498] $^1\text{H-NMR}$ データ(CDCl_3/TMS δ (ppm)):

3.94(3H, s)、6.76(1H, d)、6.84(1H, dd)、7.88(1H, dd)、7.96(1H, dd)、8.37(1H, dd)、8.42(1H, d)、9.90(1H, d)、10.20(1H, s)

[0499] (5) エチル 1-(6-メトキシ-3-ピリジニル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-カルボキシレート

2-(6-メトキシ-3-ピリジニルアミノ)ニコチンアルデヒド6.4 g (28 mmol) をエタノール(50 mL)に溶解し、マロン酸ジエチル

6. 7 g (42 mmol) とピペリジン 0.95 g (11 mmol) を加え 100°C で 4 時間撹拌した。反応混合物から溶媒を減圧留去し、残渣を酢酸エチルとジイソプロピルエーテルの混合溶液で洗浄して、淡黄色固体の標記化合物を 4.1 g 得た (収率 45%)。

[0500] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

1.41 (3H, t)、4.00 (3H, s)、4.43 (2H, q)、6.92 (1H, d)、7.24 (1H, dd)、7.51 (1H, dd)、8.03 (1H, d)、8.08 (1H, d)、8.49 (1H, s)、8.54 (1H, dd)

[0501] (5) 1-(6-メトキシ-3-ピリジニル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-カルボン酸の製造

エチル (6-メトキシ-3-ピリジニル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-カルボキシレート 4.1 g (13 mmol) を 1,4-ジオキサン (60 mL) に溶解し、室温で炭酸カリウム 2.6 g (19 mmol) と水 100 mL を加え、60°C で 3 時間撹拌した。反応混合物から溶媒を減圧留去し、残渣を水に溶解し、クロロホルムで洗浄した。水相に濃塩酸を加え酸性とし、クロロホルムで抽出し、有機相を乾燥、濃縮して無色結晶の標記化合物を 1.45 g 得た (収率 39%)。

[0502] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

4.04 (3H, s)、6.99 (1H, d)、7.42 (1H, dd)、7.52 (1H, dd)、8.12 (1H, d)、8.23 (1H, d)、8.68 (1H, dd)、9.04 (1H, s)、13.76 (1H, s)

[0503] [参考例 9]

(製造中間体) 1-(2,3-ジヒドロベンゾ[b][1,4]ジオキシ-6-イル)-2-オキソ-1,2-ジヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-カルボン酸の製造 (製造中間体の化合物番号 VII I-26)

(1) メチル 2-(トリフルオロメチルスルホニルオキシ)ニコチネートの製造

メチル 2-ヒドロキシニコチネート 12.4 g (81 mmol) をジクロロメタン 150 mL に溶解し、トリエチルアミン 9.0 g (89 mmol) を加えた後、無水トリフルオロメタンスルホン酸 25.1 g (89 mmol)

1) を -30°C で滴下した。反応混合物を室温下で5時間反応させ、水にあげ室温で1時間攪拌した後、ジクロロメタンで抽出た。有機相を水で洗浄後、乾燥、濃縮して橙色液体の標記化合物 21.2 g を得た (収率 92%)。

[0504] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

4.00 (3H, s)、7.49–7.53 (1H, m)、8.49 (1H, dd)、8.54 (1H, dd)

[0505] (2) メチル 2-(2,3-ジヒドロベンゾ[b][1,4]ジオキシシン-6-イル) アミノニコチネートの製造

メチル 2-(トリフルオロメチルスルホニルオキシ) ニコチネート 10.6 g (37 mmol) と 3,4-エチレンジオキシベンジルアミン 6.2 g (41 mmol) をトルエン (100 mL) に溶解し、炭酸セシウム 17.0 g (52 mmol)、トリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム (0) 1.0 g (1.1 mmol)、4,5-ビス (ジフェニルホスフィノ) -9,9-ジメチルキサンテン 1.3 g (5.2 mmol) を加え 80°C で2時間加熱攪拌した。反応混合物から溶媒を留去し、水と酢酸エチルを加えてろ過した。ろ液を酢酸エチルで抽出し、有機相をクエン酸水溶液、水の順で洗浄後、乾燥、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 9 ~ 1 : 2) で精製し橙色粘稠体の標記化合物を 9.86 g 得た (収率 93%)。

$^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

3.91 (3H, s)、4.24 (4H, br)、6.64–6.66 (1H, m)、6.83 (1H, d)、6.97 (1H, dd)、7.37 (1H, d)、8.19 (1H, dd)、8.33 (1H, dd)、9.92 (1H, br)

[0506] (3) 2-(2,3-ジヒドロベンゾ[b][1,4]ジオキシシン-6-イル) アミノ-3-ピリジニルメタノールの製造

窒素気流下、氷冷下で水素化リチウムアルミニウム 1.70 g (41 mmol) をテトラヒドロフラン (100 mL) に加え、メチル 2-(2,3-ジヒドロベンゾ[b][1,4]ジオキシシン-6-イル) アミノニコチネート 9.86 g (34 mmol) のテトラヒドロフラン (30 mL) 溶液を滴下した。反応混合物に、酢酸エチルを加え、続いて 10% 水酸化ナトリウム水

溶液 17 mL を加え、不溶物をろ過した。ろ液を濃縮し、残渣を酢酸エチルに溶解し、乾燥、ろ過、濃縮して橙色粘稠体の標記化合物を 8.9 g 得た（収率 定量的）た。

[0507] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

2.78 (1H, br)、4.20 (4H, br)、4.56 (1H, s)、6.59–6.63 (1H, m)、6.77–6.86 (2H, m)、7.18–7.26 (2H, m)、7.47 (1H, br)、8.07 (1H, dd)

[0508] (4) (2- (2, 3-ジヒドロベンゾ[b][1, 4]ジオキシシン-6-イル) アミノ) ニコチンアルデヒドの製造

2- (2, 3-ジヒドロベンゾ[b][1, 4]ジオキシシン-6-イル) アミノ-3-ピリジニルメタノール 8.9 g (34 mmol) をクロロホルム (100 mL) に溶解し、二酸化マンガン 10.1 g (0.10 mol) を加えて 50°C で一晩攪拌した。反応混合物をろ過し、濃縮して得られた残渣を酢酸エチルに溶解し、乾燥、ろ過、濃縮して得られた油状物をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル: n-ヘキサン = 1: 9 ~ 1: 1) で精製し橙色粘稠体の標記化合物を 7.69 g 得た (収率 87%) 。

[0509] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

4.26 (4H, br)、6.77–6.81 (1H, m)、6.87 (1H, d)、7.43 (1H, d)、7.82 (1H, dd)、8.38 (1H, dd)、9.85 (1H, s)、10.25 (1H, br)

[0510] (5) エチル 1- (2, 3-ジヒドロベンゾ[b][1, 4]ジオキシシン-6-イル) -2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレートの製造

(2- (2, 3-ジヒドロベンゾ[b][1, 4]ジオキシシン-6-イル) アミノ) ニコチンアルデヒド 7.69 g (30 mmol) をエタノール (150 mL) に溶解し、マロン酸ジエチル 7.2 g (45 mmol) とピロリジン 1.5 mL (15 mmol) を加え 100°C で一晩攪拌した。冷却して析出した固体をカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル: n-ヘキサン = 1: 1 ~ 1: 0) で精製し淡黄色固体の標記化合物を 4.3 g 得た (収率 41%) 。

[0511] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

1.40 (3H, t)、4.31 (4H, br)、4.42 (2H, q)、6.73 (1H, dd)、6.79 (1H, d)、7.03 (1H, d)、7.18–7.23 (1H, m)、8.00 (1H, dd)、8.46 (1H, s)、8.58 (1H, dd)

[0512] (6) 1 – (2, 3 – ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシシン – 6 – イル) – 2 – オキソ – 1, 2 – ジヒドロ – 1, 8 – ナフチリジン – 3 – カルボン酸の製造

エチル 1 – (2, 3 – ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシシン – 6 – イル) – 2 – オキソ – 1, 2 – ジヒドロ – 1, 8 – ナフチリジン – 3 – カルボキシレート 4.3 g (12 mmol) を 1, 4 – ジオキサン (100 mL) に溶解し、室温で水酸化リチウム – 水和物 1.0 g (24 mmol) と水 50 mL を加え、室温で一晩攪拌した。反応混合物に水を加え、析出した固体をクロロホルムに溶解した。この溶液をクエン酸水溶液、水の順で洗浄し、乾燥、濃縮し、得られた固体をジイソプロピルエーテルで洗浄して淡黄色結晶の標記化合物を 3.96 g 得た (収率 定量的)。

[0513] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

4.34 (4H, br)、6.75 (1H, dd)、6.82 (1H, d)、7.09 (1H, d)、7.37–7.42 (1H, m)、8.20 (1H, dd)、8.72 (1H, dd)、9.02 (1H, s)、13.94 (1H, s)

[0514] [参考例 10]

(製造中間体) 1 – メチル – 2 – オキソ – 7 – (トリフルオロメチル) – 1, 2 – ジヒドロ – 1, 8 – ナフチリジン – 3 – カルボン酸の製造 (製造中間体の化合物番号 V I I I – 33)

(1) エチル 2 – アミノ – 6 – (トリフルオロメチル) ニコチネートの製造

エチル 3 – アミノ – 3 – イミノプロパノエート (ケミカル・アンド・ファーマシューティカル・ビュレティン (Chemical and Pharmaceutical Bulletin)、第 43 巻、第 5 号、793 頁 (1995 年) に記載) 19.5 g (0.12 mol) をアセトニトリル 100 mL に加え、室温下で 1, 8 – ジアザビシクロ [5.4.0] – 7 – ウンデセン 18.6 g (0.12 mol)

を加えて5分攪拌した。この混合物に4-エトキシ-1,1,1-トリフルオロ-3-ブテン-2-オン20.6g(0.12mol)を加え、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン18.6g(0.12mol)を加えて、80℃で3時間攪拌した。反応混合物から溶媒を減圧留去して半分まで濃縮し、氷水を加えた。析出した結晶をろ別し酢酸エチルに溶解させた。ろ液は酢酸エチルで抽出し、結晶を溶解させた溶液と抽出した有機相を合わせ、食塩水で洗浄後、乾燥、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:9~1:4)で精製し無色結晶の標記化合物を17.8g得た(収率62%)。

[0515] $^1\text{H-NMR}$ データ(CDCl_3/TMS δ (ppm)):
1.40(3H, s)、4.38(2H, q)、5.5-7.5(2H, br)、6.95(1H, d, $J=7.95\text{Hz}$)、8.29(1H, d, $J=7.95\text{Hz}$)

[0516] (2) エチル 2-ホルムアミド-6-(トリフルオロメチル)ニコチネートの製造

エチル 2-アミノ-6-(トリフルオロメチル)ニコチネート5.0g(21mmol)とギ酸10mLを混合し、100℃で一昼夜加熱攪拌した。反応混合物を冷却後、濃縮し、残渣をカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:9~4:6)で精製し無色結晶の標記化合物を3.7g得た(収率66%)。

[0517] $^1\text{H-NMR}$ データ(CDCl_3/TMS δ (ppm)):
1.44(3H, s)、4.45(2H, q)、7.43(1H, d, $J=8.22\text{Hz}$)、8.50(1H, d, $J=7.38\text{Hz}$)、9.71(1H, d, $J=9.87\text{Hz}$)、10.59(1H, br)

(3) 2-(メチルアミノ)-6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジンメタノールの製造

窒素気流下で水素化リチウムアルミニウム1.75g(42mmol)をテトラヒドロフラン(100mL)に加え、エチル 2-ホルムアミド-6-(トリフルオロメチル)ニコチネート3.7g(14mmol)のテトラヒドロフラン(30mL)溶液を滴下し、40℃で2時間攪拌した。反応混

合物に、酢酸エチルを加え、続いて10%水酸化ナトリウム水溶液18mLを加え、不溶物をろ過した。ろ液を濃縮し、得られた残渣を酢酸エチルに溶解し、乾燥、ろ過、濃縮して得られた固体をジイソプロピルエーテルで洗浄して淡黄色結晶の標記化合物を2.30g得た（収率79%）。

[0518] $^1\text{H-NMR}$ データ（ CDCl_3/TMS δ （ppm））：

3.04(3H, d)、4.61(2H, s)、4.56(1H, s)、6.84(1H, d)、7.27(1H, d)

[0519] (4) 2-(メチルアミノ)-6-(トリフルオロメチル)-3-ニコチンアルデヒドの製造

2-(メチルアミノ)-6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジンメタノール2.3g(11mmol)をクロロホルム(100mL)に溶解し、二酸化マンガン3.3g(33mmol)を加えて50°Cで8時間攪拌した。反応混合物をろ過し、ろ液を濃縮して残渣をカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：n-ヘキサン=1：4～3：7）で精製し黄色固体の標記化合物を1.26g得た（収率55%）。

[0520] $^1\text{H-NMR}$ データ（ CDCl_3/TMS δ （ppm））：

3.10(3H, d)、6.93(1H, d)、7.86(1H, d)、8.38(1H, br)、9.88(1H, br)

[0521] (5) エチル 1-メチル-2-オキソ-7-(トリフルオロメチル)-1,2-ジヒドロ-1,8-ナフチリジン-3-カルボキシレート

2-(メチルアミノ)-6-(トリフルオロメチル)-3-ニコチンアルデヒド1.26g(6.2mmol)をエタノール(50mL)に溶解し、マロン酸ジエチル1.5g(9.4mmol)とピロリジン0.3mL(3mmol)を加え100°Cで一晩攪拌した。反応混合物を冷却後、濃縮して析出した固体をジイソプロピルエーテルで洗浄して淡黄色固体の標記化合物を1.24g得た（収率67%）。

[0522] $^1\text{H-NMR}$ データ（ CDCl_3/TMS δ （ppm））：

1.43(3H, t)、3.87(3H, s)、4.44(2H, q)、7.56(1H, d)、8.14(1H, d)、8.35(1H, s)

[0523] (6) 1-メチル-2-オキソ-7-(トリフルオロメチル)-1,2-ジ

ヒドロー 1, 8-ナフチリジン-3-カルボン酸の製造

エチル 1-メチル-2-オキソ-7-(トリフルオロメチル)-1, 2-ジヒドロー 1, 8-ナフチリジン-3-カルボキシレート 1. 24 g (4. 1 mmol) を 1, 4-ジオキサン (50 mL) に溶解し、室温下で水酸化リチウム-水和物 0. 35 g (8. 3 mmol) と水 10 mL を加え、室温で一晩攪拌した。反応混合物を炭酸水素ナトリウム水溶液にあげ、酢酸エチルで洗浄し、水相をクエン酸で酸性にしてから酢酸エチルで抽出した。有機相を水洗、乾燥、濃縮し、残渣をノルマルヘキサンで洗浄して無色結晶の標記化合物を 1. 02 g 得た (収率 91%) 。

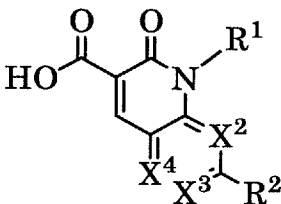
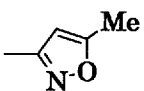
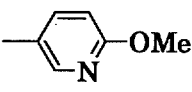
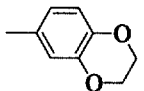
[0524] $^1\text{H-NMR}$ データ (CDCl_3/TMS δ (ppm)) :

4. 01 (3H, s)、7. 74 (1H, d)、8. 37 (1H, d)、8. 96 (1H, s)、14. 04 (1H, s)

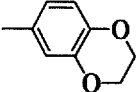
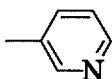
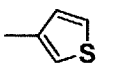
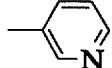
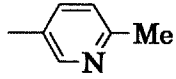
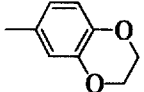
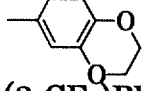
[0525] 前記中間体製造例に準じて製造した本発明化合物 [I] の中間体の構造式を、前記参考例 1 ~ 10 を含め以下に示す。ただし、表中の記号は前記と同様の意味を表す。

[0526]

[表68]

					
化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
VIII-1	Me	H	CH	CH	CH
VIII-2	(4-OMe)Ph	H	CH	CH	CH
VIII-3	Et	H	CH	CH	CCl
VIII-4	Me	H	N	CH	CH
VIII-5	Et	H	N	CH	CH
VIII-6	n-Pr	H	N	CH	CH
VIII-7	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	H	N	CH	CH
VIII-8	CH ₂ SEt	H	N	CH	CH
VIII-9	Bn	H	N	CH	CH
VIII-10	(2-Cl)Bn	H	N	CH	CH
VIII-11	(3-Cl)Bn	H	N	CH	CH
VIII-12	(4-Cl)Bn	H	N	CH	CH
VIII-13	(2-OMe)Bn	H	N	CH	CH
VIII-14	(3-OMe)Bn	H	N	CH	CH
VIII-15	(4-OMe)Bn	H	N	CH	CH
VIII-16	Ph	H	N	CH	CH
VIII-17	(3-F)Ph	H	N	CH	CH
VIII-18	(3-Me)Ph	H	N	CH	CH
VIII-19	(3-CF ₃)Ph	H	N	CH	CH
VIII-20	(2-OMe)Ph	H	N	CH	CH
VIII-21	(3-OMe)Ph	H	N	CH	CH
VIII-22	(4-OMe)Ph	H	N	CH	CH
VIII-23	(2,5-Me ₂)Ph	H	N	CH	CH
VIII-24		H	N	CH	CH
VIII-25		H	N	CH	CH
VIII-26		H	N	CH	CH

[0527] [表69]

化合物番号	R ¹	R ²	X ²	X ³	X ⁴
VIII-27	Me	Me	N	CH	CH
VIII-28	Ph	Me	N	CH	CH
VIII-29	Me	i-Pr	N	CH	CH
VIII-30	Ph	i-Pr	N	CH	CH
VIII-31	Me	CHF ₂	N	CH	CH
VIII-32	Ph	CHF ₂	N	CH	CH
VIII-33	Me	CF ₃	N	CH	CH
VIII-34	Ph	CF ₃	N	CH	CH
VIII-35	Me	CF ₂ Cl	N	CH	CH
VIII-36	Ph	CF ₂ Cl	N	CH	CH
VIII-37	Me	Et	N	CH	CH
VIII-38		CHF ₂	N	CH	CH
VIII-39	Me	H	CH	CH	N
VIII-40	Ph	H	CH	CH	N
VIII-41	Ph	H	N	N	CH
VIII-42	CH ₂ SO ₂ Et	H	N	CH	CH
VIII-43		CF ₃	N	CH	CH
VIII-44	Et	H	CH	CH	CF
VIII-45	(4-OMe)Ph	H	CH	CH	CF
VIII-46	c-Pr	H	N	CH	CH
VIII-47	(3-Cl)Ph	H	N	CH	CH
VIII-48	(4-Cl)Ph	H	N	CH	CH
VIII-49		H	N	CH	CH
VIII-50		H	N	CH	CH
VIII-51		H	N	CH	CH
VIII-52	CH ₂ OCH ₂ - 	H	N	CH	CH
VIII-53		Et	N	CH	CH
VIII-54		CF ₃	N	CH	CH
VIII-55	(3-CF ₃)Ph	H	CH	CH	CF

[0528] 上記の参考例の物性値を以下に示す。

[0529] [表70]

化合物 番号	融点(°C)又は 屈折率(n_D^{20})
VIII-1	融点 220 - 223
VIII-2	融点 255 - 256
VIII-3	融点 192 - 195
VIII-4	融点 220 - 222
VIII-5	融点 180 - 182
VIII-6	融点 155 - 157
VIII-7	融点 141 - 142
VIII-8	融点 168 - 170
VIII-9	融点 170 - 173
VIII-10	融点 212 - 214
VIII-11	融点 184 - 185
VIII-12	融点 220 - 222
VIII-13	融点 188 - 191
VIII-14	融点 152 - 154
VIII-15	融点 193 - 195
VIII-16	融点 239 - 241
VIII-17	融点 176 - 178
VIII-18	融点 235 - 237
VIII-19	融点 195 - 196
VIII-20	融点 264 - 266
VIII-21	融点 272 - 274
VIII-22	融点 265 - 268
VIII-23	融点 211 - 214
VIII-24	融点 224 - 226
VIII-25	融点 256 - 258
VIII-26	融点 242 - 244
VIII-27	融点 230 - 233
VIII-28	融点 242 - 244
VIII-29	融点 165 - 168
VIII-30	融点 213 - 215
VIII-31	融点 174 - 176
VIII-32	融点 176 - 178
VIII-33	融点 183 - 186
VIII-34	融点 177 - 180
VIII-35	融点 172 - 174
VIII-36	融点 231 - 233
VIII-37	融点 162 - 165
VIII-38	融点 203 - 206
VIII-39	融点 187 - 189
VIII-40	融点 254 - 256
VIII-42	融点 196 - 198
VIII-43	融点 180 - 182

[0530] 前記中間体製造例に準じて製造した本発明化合物 [I] の中間体の化合物番号 V I I I - 4 1 の¹H-NMR値を以下に示す。

- [0531] 化合物番号ⅤⅠⅠⅠ－４１ (CDCl₃/ TMS δ (ppm)) : 7.17-7.30 (2H, m), 7.54-7.67 (3H, m), 9.07 (1H, s), 9.11 (1H, s), 9.24 (1H, s), 13.30 (1H, br)

次に代表的な製剤例をあげて製剤方法を具体的に説明する。化合物、添加剤の種類及び配合比率は、これのみに限定されることなく広い範囲で変更可能である。以下の説明において「部」は重量部を意味する。

[0532] 〈製剤例１〉 水和剤

化合物番号ⅠⅠ－２の化合物	１０部
ポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテル	０．５部
β－ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物ナトリウム塩	０．５部
珪藻土	２０部
クレー	６９部

以上を均一に混合粉碎して水和剤とした。又、化合物番号ⅠⅠ－２に代えて、表１～６６に記載の化合物各々を用いて同様に水和剤を得ることができた。

[0533] 〈製剤例２〉 フロアブル剤

化合物番号ⅠⅠ－４１の化合物	２０部
水	６９部
ポリオキシエチレンスチレン化フェニルエーテル硫酸塩	４部
エチレングリコール	７部

以上にシリコーンＡＦ－１１８Ｎ（旭化成工業株式会社製）を全量に対し２００ppm加え、高速攪拌機にて３０分間混合した後、湿式粉碎機にて粉碎しフロアブル剤とした。また、化合物番号ⅠⅠ－４１に代えて、表１～６６に記載の化合物各々を用いて同様にフロアブル剤を得ることができる。

[0534] 〈製剤例３〉 乳剤

化合物番号ⅠⅠⅠ－１１８の化合物	３０部
キシレンとイソホロンの等量混合物	６０部
ポリオキシエチレンソルビタンアルキレート	４部

ポリオキシエチレンポリアルキルアリールエーテル 4 部

アルキルアリールスルホネート 2 部

以上を均一に溶解して乳剤とした。また、化合物番号 I I I - 1 1 8 に代えて、表 1 ~ 6 6 に記載の化合物各々を用いて同様に乳剤を得ることができる。

[0535] 〈製剤例 4〉 粒剤

化合物番号 I V - 4 1 の化合物 1 0 部

タルクとベントナイトの (1 : 3) 混合物 8 0 部

ホワイトカーボン 5 部

ポリオキシエチレンソルビタンアルキレート 2 部

ポリオキシエチレンポリアルキルアリールエーテル 2 部

アルキルアリールスルホネート 1 部

以上を均一に混合粉碎した。この混合物に水 1 0 部相当量を加えて練合し、押出式造粒機を用いて直径 0 . 7 mm のふるい穴から押し出して乾燥した後、0 . 5 ~ 1 mm の長さに切断し、粒剤とした。また、化合物番号 I V - 4 1 に代えて、表 1 ~ 6 6 に記載の化合物各々を用いて同様に粒剤を得ることができる。

[0536] また、表 1 ~ 6 6 に記載の化合物は、製剤例 1 ~ 4 に記載の方法に準じて同様の各種製剤を製造することができる。

[0537] 次に試験例をあげて本発明化合物の除草活性について説明する。

〈試験例 1〉 水田土壌処理による除草効果試験

1 0 0 c m² プラスチックポットに水田土壌を充填し、代掻後、タイヌビエ、コナギ、イヌホタルイの種子を播種し、水深 3 c m に湛水した。翌日、製剤例 1 に準じて調製した水和剤を水で希釈し、水面滴下した。施用量は、有効成分を、1 ヘクタール当り 1 0 0 0 g 相当とした。その後、温室内で育成し、処理後 2 1 日目に次の表 7 1 に記載の基準に従って除草効果を調査した。

[0538]

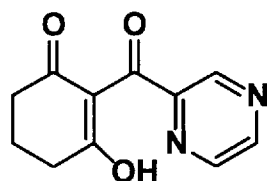
[表71]

指 数	除草効果（生育抑制程度）及び薬害
5	90%以上の抑制の除草効果、薬害
4	70%以上90%未満の除草効果、薬害
3	50%以上70%未満の除草効果、薬害
2	30%以上50%未満の除草効果、薬害
1	10%以上30%未満の除草効果、薬害
0	0%以上10%未満の除草効果、薬害

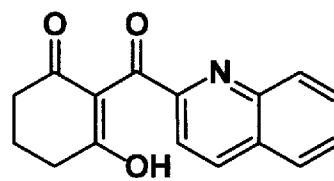
[0539] その結果を、表72～73に示す。

[0540] なお、表中の比較化合物A、及び比較化合物B、比較化合物C及び比較化合物Dは、それぞれ欧州特許公開EP-283261号に記載された化合物番号70、34、32及び31である。これらの化合物の構造式を以下に示す。

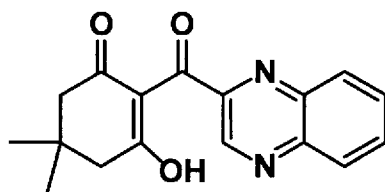
[0541] [化26]



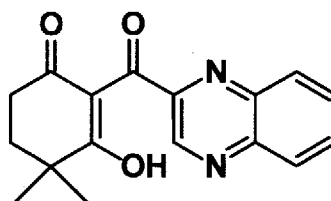
比較化合物A



比較化合物B



比較化合物C



比較化合物D

[0542]

[表72]

化合物番号	タイヌビエ	コナギ	イヌホタルイ
I-2	5	5	5
I-56	5	5	5
I-157	5	4	3
II-2	5	5	5
II-3	5	5	5
II-4	5	5	5
II-15	5	5	5
II-19	5	5	5
II-24	5	5	5
II-28	5	5	5
II-29	5	5	5
II-30	4	5	5
II-37	5	5	5
II-38	5	5	5
II-39	5	5	5
II-41	5	5	5
II-43	5	5	5
II-48	5	5	5
II-52	5	5	5
II-54	5	5	5
II-55	5	5	5
II-56	5	5	5
II-58	5	5	5
II-63	5	5	5
II-92	5	5	5
II-118	5	5	5
II-121	5	5	5
II-123	5	5	5
II-126	3	5	4
II-128	5	5	5
II-131	5	5	5
II-133	5	5	5
II-136	5	5	5
II-138	5	5	5
II-141	5	5	5
II-143	5	5	5
II-434	5	5	5
II-442	5	5	5

[0543] [表73]

化合物番号	タイヌビエ	コナギ	イヌホタルイ
III-41	4	4	4
IV-41	5	5	5
V-41	5	5	5
比較化合物A	2	0	0
比較化合物B	0	0	0
比較化合物C	1	2	1
比較化合物D	1	4	2

[0544] 〈試験例2〉 畑地土壌処理による除草効果試験

80cm²プラスチックポットに畑土壌を充填し、イチビ、アオゲイトウの種子を播種して覆土した。製剤例1に準じて調製した水和剤を水で希釈し、1ヘクタール当り有効成分が1000gになるように、1ヘクタール当り1000リットル相当を小型噴霧器で土壌表面に均一に散布した。その後、温室内で育成し、処理21日目に前記した表71に記載の基準に従って、除草効果を調査した。結果を次の表74に示す。

[0545]

[表74]

化合物番号	イヌビエ	エノコログサ	イチビ	アオゲイトウ
II-2	5	5	5	5
II-4	5	4	5	5
II-15	5	5	5	5
II-19	4	4	5	5
II-24	5	3	5	5
II-41	5	5	5	5
II-43	5	5	5	5
II-48	5	5	4	5
II-52	5	5	5	5
II-54	5	5	5	5
II-55	5	5	5	5
II-56	5	5	5	5
II-58	5	5	5	5
II-63	4	3	5	5
II-92	5	4	5	5
II-118	5	5	5	5
II-123	5	5	5	5
II-128	5	5	4	5
II-131	4	3	5	5
II-133	5	5	5	5
II-136	5	4	4	5
II-141	3	4	5	3
II-143	5	5	5	5
IV-41	5	5	5	5
V-41	5	4	5	4
比較化合物A	5	1	1	0
比較化合物B	3	0	2	2
比較化合物C	2	0	0	3
比較化合物D	2	0	0	3

[0546] 〈試験例3〉 畑地茎葉処理による除草効果試験

80 cm²プラスチックポットに畑土壌を充填し、イヌビエ、イチビ、アオゲイトウの種子を播種し、温室内で2週間育成後、製剤例1に準じて調製した水和剤を水で希釈し、1ヘクタール当り有効成分が1000 gになる様に、1ヘクタール当り1000リットル相当を小型噴霧器で植物体の上方から全体に茎葉散布処理した。その後、温室内で育成し、処理14日目に前記し

た表 7 1 に記載の基準に従って、除草効果を調査した。その結果を次の表 7 5 に示す。

[0547] [表75]

化合物番号	イヌビエ	エノコログサ	イチビ	アオゲイトウ
I-56	3	3	5	5
II-2	5	4	5	5
II-3	5	4	5	5
II-4	5	4	5	5
II-15	5	5	5	5
II-19	5	5	5	5
II-28	4	3	5	5
II-39	5	3	5	5
II-41	5	5	5	5
II-43	5	5	5	5
II-48	5	5	5	5
II-52	5	5	5	5
II-54	5	5	5	5
II-55	5	5	5	5
II-56	5	5	5	5
II-58	5	5	5	5
II-63	5	5	5	5
II-92	5	5	5	5
II-118	5	5	5	5
II-121	4	3	5	5
II-123	5	5	5	5
II-128	5	5	5	5
II-131	4	4	5	5
II-133	5	5	5	5
II-136	5	4	5	5
II-138	5	5	5	3
II-141	3	4	5	4
II-143	5	5	5	5
IV-41	5	5	5	5
V-41	5	4	5	5
比較化合物A	0	0	2	1
比較化合物B	0	0	5	1
比較化合物C	0	0	4	0
比較化合物D	0	0	4	1

[0548] 以上の結果から本発明の化合物が優れた除草活性を有していることがわか

る。

産業上の利用可能性

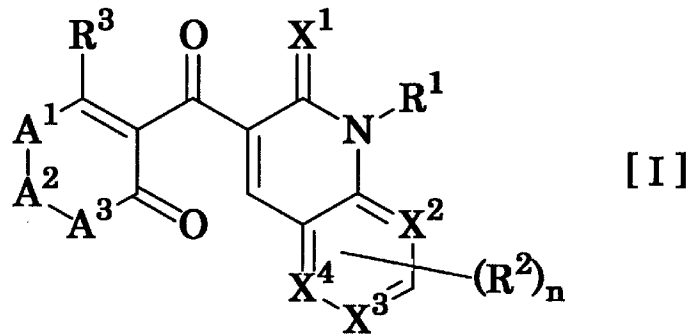
[0549] 本発明は、優れた除草活性を有する新規な化合物を提供するものであり、農薬分野、農業分野において有用であり、産業上の利用可能性を有する。

請求の範囲

[請求項1]

一般式 [I]

[化1]



{式中、X¹は、酸素原子又は硫黄原子を表し、

X²、X³及びX⁴は、CH（当該炭素原子はR²により置換されてもよい。）；又はN（O）_mを表し、

mは、0又は1の整数を表し、

R¹は、水素原子；C₁～C₁₂アルキル基；C₂～C₆アルケニル基；C₂～C₆アルキニル基；C₃～C₈シクロアルキル基；C₃～C₈シクロアルキルC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆ハロアルキル基；C₂～C₆ハロアルケニル基；C₂～C₆ハロアルキニル基；C₃～C₈ハロシクロアルキル基；C₃～C₈ハロシクロアルキルC₁～C₆アルキル基；アミノC₁～C₆アルキル基；ニトロC₁～C₆アルキル基；モノ（C₁～C₆アルキル）アミノC₁～C₆アルキル基；ジ（C₁～C₆アルキル）アミノC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆アルキルチオC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆アルキルスルフィニルC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆アルキルスルホニルC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆ハロアルキルチオC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆ハロアルキルスルフィニルC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆ハロアルキルスルホニルC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基；ヒドロキシC₁～C₆アルキル基；フェニルC₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基（該基のフェニルは、1又は2～5個の同一もしくは異なるR⁴により置

換されてもよい。) ; $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基 ; $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルオキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基 ; $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基 ; フェニルオキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基 (該基のフェニルは、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^4 により置換されてもよい。) ; 酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環オキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基 (該基の酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環は、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^5 により置換されてもよい。) ; フェニルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基 (該基のフェニルは、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^4 により置換されてもよい。) ; フェニルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基 (該基のフェニルは、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^4 により置換されてもよい。) ; フェニルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基 (該基のフェニルは、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^4 により置換されてもよい。) ; $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ $C_1 \sim C$

$_6$ アルキル基 ; 酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基 (該基の酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環は、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^5 により置換されてもよい。) ; $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基 ; $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基 ; $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基 ; シアノ $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基 ; シアノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基 ; $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基 ; $C_1 \sim C_6$ アシル $C_1 \sim C_6$ アルキル基 ; ジ ($C_1 \sim$

C₆アルコキシ) C₁~C₆アルキル基; C₁~C₆アルコキシカルボニル C₁~C₆アルキル基; C₁~C₆アルコキシイミノ C₁~C₆アルキル基; C₁~C₆アルキリデンアミノオキシ C₁~C₆アルキル基; (R⁶R⁷N-C=O) C₁~C₆アルキル基; C₆~C₁₀アリール C₁~C₆アルキル基 (該基のアリールは、1又は2~5個の同一もしくは異なるR⁴により置換されてもよい。); 酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1~5個のヘテロ原子を有する炭素数2~10の複素環 C₁~C₆アルキル基 (該基の酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1~5個のヘテロ原子を有する炭素数2~10の複素環は、1又は2~5個の同一もしくは異なるR⁵により置換されてもよい。); NR⁸R⁹基; C₁~C₆アルコキシ基; C₆~C₁₀アリール基 (該基は1又は2~5個の同一もしくは異なるR⁴により置換されてもよい。); 又は、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1~5個のヘテロ原子を有する炭素数2~10の複素環基 (該基は、1又は2~5個の同一もしくは異なるR⁵により置換されてもよい。)を表し、

R²は、ハロゲン原子; ヒドロキシル基; ニトロ基; シアノ基; C₁~C₆アルキル基; C₃~C₈シクロアルキル基; C₃~C₈シクロアルキル C₁~C₆アルキル基; C₂~C₆アルケニル基; C₂~C₆アルキニル基; C₁~C₆ハロアルキル基; C₂~C₆ハロアルケニル基; C₂~C₆ハロアルキニル基; C₃~C₈ハロシクロアルキル基; C₃~C₈ハロシクロアルキル C₁~C₆アルキル基; C₁~C₆アルコキシ基; C₃~C₈シクロアルキルオキシ基; C₃~C₈シクロアルキル C₁~C₆アルキルオキシ基; C₂~C₆アルケニルオキシ基; C₂~C₆アルキニルオキシ基; C₁~C₆ハロアルコキシ基; C₁~C₆アルコキシ C₁~C₆アルコキシ基; C₁~C₆アルキルカルボニルオキシ基; C₁~C₆アルキルチオ基; C₁~C₆アルキルスルフィニル基; C₁~C₆アルキルスルホニル基; C₁~C₆ハロアルキルチオ基; C₁~C₆ハロ

アルキルスルフィニル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル基；アミノ基；モノ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノ基；ジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノ基； $C_1 \sim C_6$ アシルアミノ基；ヒドロキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基；シアノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アシル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシイミノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基；カルボキシル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル基；カルバモイル基；モノ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノカルボニル基；ジ（ $C_1 \sim C_6$ アルキル）アミノカルボニル基；又は、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環基（該基の酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環は、1又は2～5個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。）を表し、

また、 R^2 は、隣接した2個の R^2 が一緒になって、それぞれの R^2 が直接結合している炭素原子と共に、炭素環又は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～4個のヘテロ原子を有する複素環である4～8員環を形成してもよく、このときに形成された環はハロゲン原子；シアノ基；ニトロ基； $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基；又はオキシ基で置換されてもよく、

n は、 X^2 、 X^3 及び X^4 がCH（該炭素原子は R^2 により置換されてもよい。）即ち、置換基 R^2 により置換されてもよいCHである場合は0～4の整数を表し、

R^3 は、ヒドロキシル基； O^-M^+ （ M^+ はアルカリ金属カチオン又は

アンモニウムカチオンを示す。) ; アミノ基 ; ハロゲン原子 ; $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ基 ; $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基 ; $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル基 ; $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル基 ; $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ基 ; $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル基 ; $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル基 ; $C_2 \sim C_6$ アルケニルチオ基 ; $C_2 \sim C_6$ アルケニルスルフィニル基 ; $C_2 \sim C_6$ アルケニルスルホニル基 ; $C_2 \sim C_6$ アルキニルチオ基 ; $C_2 \sim C_6$ アルキニルスルフィニル基 ; $C_2 \sim C_6$ アルキニルスルホニル基 ; $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ基 ; $C_2 \sim C_6$ アルケニルカルボニルオキシ基 ; $C_2 \sim C_6$ アルキニルカルボニルオキシ基 ; フェノキシ基 (該基は、1 又は 2 ～ 5 個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。) ; フェニルチオ基 (該基は、1 又は 2 ～ 5 個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。) ; フェニルスルフィニル基 (該基は、1 又は 2 ～ 5 個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。) ; フェニルスルホニル基 (該基は、1 又は 2 ～ 5 個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。) ; フェニルスルホニルオキシ基 (該基は、1 又は 2 ～ 5 個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。) ; フェニルカルボニルオキシ基 (該基は、1 又は 2 ～ 5 個の同一もしくは異なる R^{10} により置換されてもよい。) ; 1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基 ; 1, 2, 3-トリアゾール-1-イル基 ; 1, 2, 3-トリアゾール-2-イル基 ; イミダゾール-1-イル基 ; ピラゾール-1-イル基 ; テトラゾール-1-イル基 ; 又はテトラゾール-2-イル基を表し、
 R^4 は、ハロゲン原子 ; ヒドロキシル基 ; ニトロ基 ; シアノ基 ; $C_1 \sim C_6$ アルキル基 ; $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基 ; $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル $C_1 \sim C_6$ アルキル基 ; $C_2 \sim C_6$ アルケニル基 ; $C_2 \sim C_6$ アルキニル基 ; $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基 ; $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基 ; $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル基 ; $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル基 ; $C_3 \sim$

C₈ハロシクロアルキルC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆アルコキシ基；C₃～C₈シクロアルキルオキシ基；C₂～C₆アルケニルオキシ基；C₂～C₆アルキニルオキシ基；C₁～C₆アルキルカルボニルオキシ基；C₁～C₆ハロアルコキシ基；C₁～C₆アルキルチオ基；C₁～C₆アルキルスルフィニル基；C₁～C₆アルキルスルホニル基；C₁～C₆ハロアルキルチオ基；C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル基；C₁～C₆ハロアルキルスルホニル基；アミノ基；C₁～C₆アシルアミノ基；モノ（C₁～C₆アルキル）アミノ基；ジ（C₁～C₆アルキル）アミノ基；ヒドロキシC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆アルキルチオC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆アルキルスルフィニルC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆アルキルスルホニルC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆ハロアルキルチオC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆ハロアルキルスルフィニルC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆ハロアルキルスルホニルC₁～C₆アルキル基；シアノC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルコキシ基；C₃～C₈シクロアルキルC₁～C₆アルキルオキシ基；C₁～C₆ハロアルコキシC₁～C₆アルコキシ基；シアノC₁～C₆アルコキシ基；C₁～C₆アシル基；C₁～C₆アルコキシイミノC₁～C₆アルキル基；カルボキシ基；C₁～C₆アルコキシカルボニル基；カルバモイル基；モノ（C₁～C₆アルキル）アミノカルボニル基；ジ（C₁～C₆アルキル）アミノカルボニル基；酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環基（該基の複素環は、1又は2～5個の同一もしくは異なるR¹⁰により置換されてもよい。）；

又は、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より任意に選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環オキシ基（該基の酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～5個のヘテロ原子を有する炭素数2～10の複素環は、1又は2～5個の同一もしくは

異なるR¹⁰により置換されてもよい。)を表し、

また、R⁴は、隣接した2個のR⁴が一緒になって、それぞれのR⁴が直接結合している炭素原子と共に、炭素環又は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～4個のヘテロ原子を有する複素環である4～8員環を形成してもよく、このときに形成された環はハロゲン原子；シアノ基；ニトロ基；C₁～C₆アルキル基；C₁～C₆ハロアルキル基；C₁～C₆アルコキシ基；C₁～C₆ハロアルコキシ基；又はオキシ基で置換されてもよく、

R⁵は、オキシ基；チオキシ基；ヒドロキシル基；ハロゲン原子；ニトロ基；シアノ基；C₁～C₆アルキル基；C₂～C₆アルケニル基；C₂～C₆アルキニル基；C₃～C₈シクロアルキル基；C₃～C₈シクロアルキルC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆ハロアルキル基；C₂～C₆ハロアルケニル基；C₃～C₈ハロシクロアルキル基；C₃～C₈ハロシクロアルキルC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆アルコキシ基；C₂～C₆アルケニルオキシ基；C₂～C₆アルキニルオキシ基；C₃～C₈シクロアルキルオキシ基；C₃～C₈シクロアルキルC₁～C₆アルキルオキシ基；C₁～C₆ハロアルコキシ基；C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルコキシ基；C₁～C₆ハロアルコキシC₁～C₆アルコキシ基；シアノC₁～C₆アルコキシ基；C₁～C₆アルキルカルボニルオキシ基；C₁～C₆アルキルチオ基；C₁～C₆アルキルスルフィニル基；C₁～C₆アルキルスルホニル基；C₁～C₆ハロアルキルチオ基；C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル基；C₁～C₆ハロアルキルスルホニル基；アミノ基；モノ（C₁～C₆アルキル）アミノ基；ジ（C₁～C₆アルキル）アミノ基；C₁～C₆アシルアミノ基；カルボキシル基；C₁～C₆アルコキシカルボニル基；カルバモイル基；モノ（C₁～C₆アルキル）アミノカルボニル基；ジ（C₁～C₆アルキル）アミノカルボニル基；C₁～C₆アシル基；C₁～C₆アルコキシイミノC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル基；C₁～C₆ア

ルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル $C_1 \sim C_6$ アルキル基；又はシアノ $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表し、

また、 R^5 は、隣接した2個の R^5 が一緒になって、それぞれの R^5 が直接結合している炭素原子と共に、炭素環又は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子より選択される1～4個のヘテロ原子を有する複素環である4～8員環を形成してもよく、このときに形成された環はハロゲン原子；シアノ基；ニトロ基； $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基；又はオキソ基で置換されてもよく、

R^6 及び R^7 は、互いに独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基；又はフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルオキシカルボニル基を表し、

また、 R^6 及び R^7 は、これらが一緒になってこれらが結合している窒素原子と共に5～6員環を形成していてもよく、このときに形成された環中に R^6 及び R^7 が結合している窒素原子以外に酸素原子が介在していてもよく、

R^8 及び R^9 は、互いに独立して、水素原子； $C_1 \sim C_6$ アルキル基； NR^6R^7 基；又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル基を表し、

また、 R^8 及び R^9 は、これらが一緒になってこれらが結合している窒素原子と共に5～6員環を形成していてもよく、この際、この環中に R^8 及び R^9 が結合している窒素原子以外に硫黄原子及び／又は酸素原子が介在していてもよく、

R^{10} は、ハロゲン原子；ニトロ基；シアノ基； $C_1 \sim C_6$ アルキル基； $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基； $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基；又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基を表し、

A^1 は、 $C(R^{11}R^{12})$ を表し、

A^2 は、 $C(R^{13}R^{14})$ 、又は $C=O$ を表し、

A^3 は、 $C(R^{15}R^{16})$ を表し、

R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 及び R^{16} は、互いに独立して、水素原子；又は $C_1 \sim C_6$ アルキル基を表し、

また、 R^{11} と R^{16} はこれらが一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成し、隣接する炭素原子と共に環を構成しても良い。} で表される2-ピリドン誘導体又はその農薬上許容される塩。

[請求項2] 請求項1に記載の2-ピリドン誘導体又はその塩を活性成分として含有することを特徴とする除草剤。

[請求項3] 請求項2に記載の除草剤の有効量を土壌及び／又は植物に処理することを特徴とする除草剤の使用。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2010/000607

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D215/22(2006.01)i, A01N43/42(2006.01)i, A01N43/90(2006.01)i, A01P13/00(2006.01)i, C07D471/04(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)

C07D215/22, A01N43/42, A01N43/90, A01P13/00, C07D471/04

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

Jitsuyo Shinan Koho	1922-1996	Jitsuyo Shinan Toroku Koho	1996-2010
Kokai Jitsuyo Shinan Koho	1971-2010	Toroku Jitsuyo Shinan Koho	1994-2010

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

CAPLUS (STN), REGISTRY (STN), WPI

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X, Y	JP 01-006256 A (IMPERIAL CHEM IND PLC.), 10 January 1989 (10.01.1989), compounds 33, 34, 35; pages 15 to 17; claims & EP 283152 A & EP 283261 A & JP 63-264542 A & US 4912262 A & US 5041681 A & US 5210312 A	1-3
X, Y	JP 2000-016982 A (KUMIAI CHEM IND CO., LTD.), 18 January 2000 (18.01.2000), definition of R1; examples; compound no. II-10 (Family: none)	1-3

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

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

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

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

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

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

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

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

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

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
19 February, 2010 (19.02.10)

Date of mailing of the international search report
02 March, 2010 (02.03.10)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2010/000607

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 98/012180 A1 (BASF AG.), 26 March 1998 (26.03.1998), entire text & EP 931070 A1 & JP 2001-501924 A & US 6479436 B1 & EP 931070 B1 & JP 4386465 B2	1-3
A	WO 2000/014069 A1 (BASF AG., DE), 16 March 2000 (16.03.2000), entire text & EP 1112256 A1 & JP 2002-524448 A & EP 1112256 B1 & US 7030063 B1	1-3
A	WO 2000/014087 A1 (HOECHST-SCHERING AGREVO GMBH), 16 March 2000 (16.03.2000), entire text & EP 1109807 A1 & US 6297196 B1 & JP 2002-524459 A	1-3
A	JP 08-301870 A (BASF AG.), 19 November 1996 (19.11.1996), entire text & EP 669332 A2 & EP 669332 A3 & US 5723413 A	1-3
P,A	WO 2009/115788 A1 (SYNGENTA LTD., GB), 24 September 2009 (24.09.2009), entire text (Family: none)	1-3
P,A	WO 2009/016841 A1 (KUMIAI CHEM IND CO., LTD., JP), 05 February 2009 (05.02.2009), entire text & TW 200920255 A	1-3

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (I P C))

Int.Cl. C07D215/22 (2006.01) i, A01N43/42 (2006.01) i, A01N43/90 (2006.01) i, A01P13/00 (2006.01) i, C07D471/04 (2006.01) i

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (I P C))

Int.Cl. C07D215/22, A01N43/42, A01N43/90, A01P13/00, C07D471/04

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

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

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

C Aplus (STN), REGISTRY (STN), WPI

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
X, Y	JP 01-006256 A (IMPERIAL CHEM IND PLC) 1989.01.10, 化合物 33, 34, 35, p.15-17, 請求の範囲 & EP 283152 A & EP 283261 A & JP 63-264542 A & US 4912262 A & US 5041681 A & US 5210312 A	1-3
X, Y	JP 2000-016982 A (KUMIAI CHEM IND CO LTD) 2000.01.18, R1 の定義、実施例、化合物番号 II-10 (ファミリーなし)	1-3

☒ C 欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の 1 以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

1 9 . 0 2 . 2 0 1 0

国際調査報告の発送日

0 2 . 0 3 . 2 0 1 0

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (I S A / J P)

郵便番号 1 0 0 - 8 9 1 5

東京都千代田区霞が関三丁目 4 番 3 号

特許庁審査官 (権限のある職員)

岡部 佐知子

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

4 P

4 1 4 9

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
A	WO 98/012180 A1 (BASF AG) 1998.03.26, 文献全体 & EP 931070 A1 & JP 2001-501924 A & US 6479436 B1 & EP 931070 B1 & JP 4386465 B2	1-3
A	WO 2000/014069 A1 (BASF AG, DE) 2000.03.16, 文献全体 & EP 1112256 A1 & JP 2002-524448 A & EP 1112256 B1 & US 7030063 B1	1-3
A	WO 2000/014087 A1 (HOECHST-SCHERING AGREVO GMBH) 2000.03.16, 文献全体 & EP 1109807 A1 & US 6297196 B1 & JP 2002-524459 A	1-3
A	JP 08-301870 A (BASF AG) 1996.11.19, 文献全体 & EP 669332 A2 & EP 669332 A3 & US 5723413 A	1-3
P, A	WO 2009/115788 A1 (SYNGENTA LTD, GB) 2009.09.24, 文献全体 (ファミリーなし)	1-3
P, A	WO 2009/016841 A1 (KUMIAI CHEM IND CO LTD, JP) 2009.02.05, 文献全体 & TW 200920255 A	1-3