

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

(11)公表番号
特表2025-510286
(P2025-510286A)

(43)公表日 令和7年4月14日(2025.4.14)

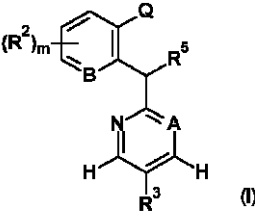
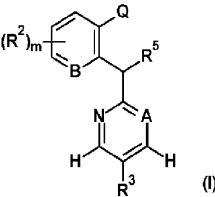
(51)国際特許分類		F I	テーマコード (参考)	
C 0 7 D 239/30 (2006.01)		C 0 7 D 239/30	C S P 4 H 0 1 1	
C 0 7 D 403/04 (2006.01)		C 0 7 D 403/04		
C 0 7 D 239/36 (2006.01)		C 0 7 D 239/36		
C 0 7 D 213/61 (2006.01)		C 0 7 D 213/61		
C 0 7 D 239/28 (2006.01)		C 0 7 D 239/28		
審査請求 未請求		予備審査請求 未請求	(全107頁)	最終頁に続く
(21)出願番号	特願2024-557150(P2024-557150)	(71)出願人	313006625	
(86)(22)出願日	令和5年3月23日(2023.3.23)		バイエル・アクチエンゲゼルシャフト	
(85)翻訳文提出日	令和6年11月22日(2024.11.22)		ドイツ連邦共和国、5 1 3 7 3・レーフ	
(86)国際出願番号	PCT/EP2023/057451		エルクーゼン、カイザー・ヴィルヘルム	
(87)国際公開番号	WO2023/186691		ーアレー・1	
(87)国際公開日	令和5年10月5日(2023.10.5)	(74)代理人	100114188	
(31)優先権主張番号	22164820.7		弁理士 小野 誠	
(32)優先日	令和4年3月28日(2022.3.28)	(74)代理人	100119253	
(33)優先権主張国・地域又は機関	欧州特許庁(EP)		弁理士 金山 賢教	
(81)指定国・地域	AP(BW,CV,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV	(74)代理人	100124855	
	最終頁に続く		弁理士 坪倉 道明	
		(74)代理人	100129713	
			弁理士 重森 一輝	
		(74)代理人	100137213	
			弁理士 安藤 健司	
			最終頁に続く	

(54)【発明の名称】 置換2-C-アジンおよびその塩、ならびにその除草性活性物質としての使用

(57)【要約】

一般式（I）の置換2-C-アジン、および除草剤としての、特に有用植物の作物中における雑草および／またはイネ科雑草を防除するための、および／または有用植物の作物の成長に影響を及ぼすための植物成長調節剤としてのその使用が記載される。本発明はまた、一般式（I）の1つ以上の化合物を含む除草剤および／または植物成長調節剤に関する。

【化1】

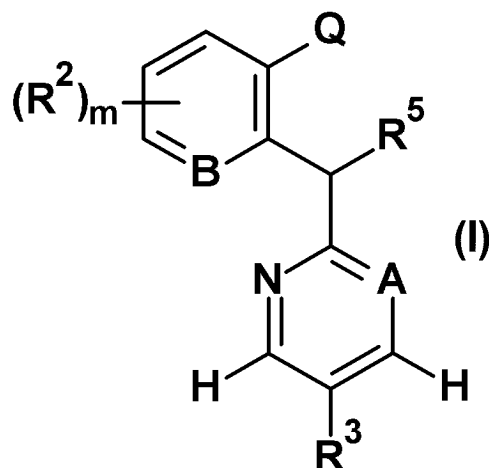


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (I) :

【化 1】



10

〔式中、

20

A は、窒素または CR^1 であり、 R^1 は、水素、 CN またはハロゲンであり、B は、 CH 、 CR^2 または N であり、

Q は、 $\text{Y} - (\text{C}_2 - \text{C}_6) - \text{ハロアルキル}$ であり、ここで、Y は、直接結合、酸素、 $\text{S}(\text{O})_n$ 、 CO または OSO_2 を表し、または

Q は、Z-アリールまたは Z-ヘテロアリールであり、ここで、アリールは、 R^4 の群から独立して選択される 1~5 個の置換基によって置換されており、ヘテロアリールは、 R^4 の群から独立して選択される 2 個までの置換基によって置換されており、および Z は、直接結合、O、 $\text{S}(\text{O})_n$ または CH_2 を表し、

30

R^2 は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{アルキル}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{ハロアルキル}$ 、シクロプロピル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{アルコキシ}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{ハロアルコキシ}$ または $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{アルキル} - \text{S}(\text{O})_n -$ であり、

m は、0、1、2 または 3 であり、

n は、0、1 または 2 であり、

R^3 は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{アルキル}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{ハロアルキル}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{アルコキシ}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_2) - \text{ハロアルコキシ}$ または $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{アルキル} - \text{S}(\text{O})_n -$ であり、

ただし、A が CR^1 である場合、 R^3 は水素であってはならず、

R^4 は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{アルキル}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_8) - \text{ハロアルキル}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{アルコキシ}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_2) - \text{ハロアルコキシ}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{アルコキシメチル}$ または $(\text{C}_1 - \text{C}_4) - \text{アルキル} - \text{S}(\text{O})_n -$ であり、

40

および

 R^5 は、水素または CN である〕

の置換 2-C-アジンまたはその塩。

【請求項 2】

式中、

A が、窒素または CR^1 であり、 R^1 が、水素、 CN またはハロゲンであり、B が、 CH 、 CR^2 または N であり、Q が、 $\text{Y} - (\text{C}_3 - \text{C}_5) - \text{ハロアルキル}$ であり、ここで、Y は、直接結合、酸素、 S

50

(O)_n、COまたはOSO₂を表し、または

Qが、Z-アリールまたはZ-ヘテロアリールであり、ここで、アリールは、R⁴の群から独立して選択される1～3個の置換基によって置換されており、ヘテロアリールは、R⁴の群から独立して選択される2個までの置換基によって置換されており、およびZは、直接結合、O、S(O)_nまたはCH₂を表し、

R²が、独立して、ハロゲン、シアノ、アミノ、(C₁–C₄)-アルキル、(C₁–C₄)-ハロアルキル、シクロプロピル、(C₁–C₄)-アルコキシ、(C₁–C₄)-ハロアルコキシまたは(C₁–C₄)-アルキル-S(O)_n-であり、

mが、0、1、2または3であり、

nが、0、1または2であり、

R³が、水素、ハロゲン、シアノ、(C₁–C₄)-アルキル、(C₁–C₄)-ハロアルキル、(C₁–C₄)-アルコキシまたは(C₁–C₂)-ハロアルコキシであり、ただし、AがCR¹である場合、R³は水素であってはならず、

R⁴が、ハロゲン、シアノ、(C₁–C₄)-アルキル、(C₁–C₈)-ハロアルキルまたは(C₁–C₄)-アルコキシメチルであり、

および

R⁵が、水素またはCNである、

請求項1に記載の一般式(I)の化合物またはその塩。

【請求項3】

式中、

Aが、窒素またはCR¹であり、

R¹が、水素、シアノ、フッ素または塩素であり、

Bが、CH、CR²またはNであり、

Qが、Y-(C₃–C₅)-ハロアルキルであり、ここで、Yは、直接結合、酸素、S、COまたはOSO₂を表し、または

Qが、Z-アリールまたはZ-ヘテロアリールであり、ここで、アリールは、R⁴の群から独立して選択される1または2個の置換基によって置換されており、ヘテロアリールは、R⁴の群から独立して選択される2個までの置換基によって置換されており、およびZは、直接結合、O、SまたはCH₂を表し、

R²が、独立して、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、CF₃またはメトキシであり、

mが、0、1または2であり、

R³が、水素、塩素、臭素、フッ素、シアノ、メチル、CF₃、メトキシまたはCHF₂Oであり、

ただし、AがCR¹である場合、R³は水素であってはならず、

R⁴が、フッ素、塩素、メチル、CHF₂、CF₃、メトキシメチルであり、

および

R⁵が、水素またはCNである、

請求項1に記載の一般式(I)の化合物またはその塩。

【請求項4】

式中、

Aが、窒素またはCR¹であり、

R¹が、水素、シアノ、フッ素または塩素であり、

Bが、CH、CR²またはNであり、

Qが、Y-(C₃–C₅)-ハロアルキルであり、ここで、Yは、直接結合、酸素、S、COまたはOSO₂を表し、または

Qが、Z-アリールまたはZ-ヘテロアリールであり、ここで、アリールは、R⁴の群から独立して選択される1または2個の置換基によって置換されており、ヘテロアリールは、R⁴の群から独立して選択される2個までの置換基によって置換されており、およびZは、直接結合、O、SまたはCH₂を表し、

R^2 が、独立して、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、 CF_3 またはメトキシであり、

m が、0、1 または 2 であり、

R^3 が、水素、塩素、臭素、フッ素、シアノ、メチル、 CF_3 、メトキシまたは CHF_2O であり、

ただし、 A が CR^1 である場合、 R^3 は水素であってはならず、

R^4 が、フッ素、塩素、メチル、 CHF_2 、 CF_3 またはメトキシメチルであり、
および

R^5 が、水素または CN である、

請求項 1 に記載の一般式 (I) の化合物またはその塩。

10

【請求項 5】

式中、

A は、窒素、 CH 、 CCN または CF であり、

B が、 CH であり、

Q が、 $(CH_2)_3CF_3$ 、 $(CH_2)_4CF_3$ 、 $S(CH_2)_3CF_3$ 、 $S(CH_2)_3Cl$ 、 $SO(CH_2)_3Cl$ 、 $SO(CH_2)_2CF_3$ 、 $SO(CH_2)_3CF_3$ 、 $SO_2(CH_2)_3CF_3$ 、 $O(CH_2)_3CF_3$ 、 $C(O)(CH_2)_3CF_3$ 、 $OSO_2(CH_2)_3CF_3$ 、 $OSO_2(CH_2)_2CF_3$ 、 $OSO_2(CH_2)_3Cl$ 、4-フルオロベンジル、4-クロロフェニル、3, 4-ジフルオロフェニル、4-フルオロフェノキシ、4-フルオロフェニルスルファニル、2, 4- Cl_2 -フェニルスルホニル、2, 4- Cl_2 -フェニルスルファニル、2, 4- Cl_2 -フェニルスルフィニル、4-(CF_3)-ピラゾール-1-イル、5- Cl -ピリミジン-2-オキシ、5- F -ピリミジン-2-オキシ、5- Cl -3- F -ピリジン-2-オキシ、3-(CHF_2)-イソオキサゾール-5-イル、5-(CHF_2)-イソオキサゾール-3-イル、1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、5-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、5-(CHF_2)-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、5-(CF_3)-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、5- F -ピリミジン-2-イルスルファニル、5- Cl -ピリミジン-2-イルスルファニル、5- Cl -ピリミジン-2-イルスルホニル、4- Cl -ピラゾール-1-イルメチル、4- Br -ピラゾール-1-イルメチルまたは 4-(CF_3)-ピラゾール-1-イルメチルであり、

20

30

R^2 が、独立して、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、 CF_3 またはメトキシであり、

m が、0、1 または 2 であり、

R^3 が、塩素、臭素またはフッ素であり、

および

R^5 が、水素または CN である、

請求項 1 に記載の一般式 (I) の化合物またはその塩。

【請求項 6】

請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の一般式 (I) の少なくとも 1 つの化合物の除草活性な量を特徴とする、除草性組成物。

40

【請求項 7】

製剤補助剤との混合物である、請求項 6 に記載の除草性組成物。

【請求項 8】

殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、殺菌剤、薬害軽減剤および成長調節剤の群からの少なくとも 1 つのさらなる農薬活性物質を含む、請求項 6 または 7 に記載の除草性組成物。

【請求項 9】

薬害軽減剤を含む、請求項 8 に記載の除草性組成物。

【請求項 10】

シプロスルファミド、クロキントセト-メキシル、メフェンピル-ジエチルまたはイ

50

ソキサジフェン－エチルを含む、請求項 9 に記載の除草性組成物。

【請求項 1 1】

さらなる除草剤を含む、請求項 6 ～ 1 0 のいずれかに記載の除草性組成物。

【請求項 1 2】

請求項 1 ～ 5 のいずれかに記載の一般式 (I) の少なくとも 1 つの化合物または請求項 6 ～ 1 0 のいずれかに記載の除草性組成物の有効量を、植物または望ましくない植生の場所に施用することを特徴とする、望ましくない植物を防除する方法。

【請求項 1 3】

望ましくない植物を防除するための、請求項 1 ～ 5 のいずれかに記載の一般式 (I) の化合物または請求項 6 ～ 1 0 のいずれかに記載の除草性組成物の使用。

10

【請求項 1 4】

一般式 (I) の化合物が、有用植物の作物中の望ましくない植物を防除するために使用されることを特徴とする、請求項 1 3 に記載の使用。

【請求項 1 5】

有用植物がトランスジェニック有用植物であることを特徴とする、請求項 1 4 に記載の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0 0 0 1】

説明

20

本発明は、作物保護製品の技術分野、特に有用植物の作物中の広葉雑草およびイネ科雑草の選択的防除のための除草剤の技術分野に関する。

具体的には、本発明が置換 2 - C - アジンおよびその塩、それらの調製方法、ならびに除草剤としてのそれらの使用に関する。

【背景技術】

【0 0 0 2】

それらの施用において、有用植物の作物の中で有害植物を選択的防除するための、これまで知られている作物保護製品または望ましくない植生を防除するための活性成分は、(a) 特定の有害植物に対して、もしあれば、不十分な除草活性を有すること、(b) 活性成分で防除することができる有害植物のスペクトルが十分に広くないこと、(c) 有用植物の作物におけるそれらの選択性が低すぎることであり、および／または (d) それらが毒物学的に好ましくないプロファイルを有することのいずれかの欠点を有することがある。さらに、いくつかの有用な植物のための植物成長調節剤として使用することができるいくつかの活性成分は、他の有用な植物における収穫量の望ましくない減少を引き起こすか、またはたとえあったとしても、狭い施用量範囲内でのみ作物植物と適合性である。既知の活性成分のいくつかは、得ることが困難な前駆体および試薬のために、工業的規模で経済的に製造することができないか、または化学的安定性が不十分である。他の活性成分の場合、その活性は、天候および土壌条件などの環境条件にあまりにも大きく依存する。

30

【0 0 0 3】

これらの公知の化合物の除草作用、特に低い施用量での除草作用、および／または作物植物とのその適合性は、依然として改善を必要としている。

40

【0 0 0 4】

A U 5 3 5 6 3 7、E P 8 1 9 2、E P 6 1 9 1 3、J P 6 1 2 3 6 7 6 6、W O 2 0 1 6 / 1 9 6 6 0 6、W O 2 0 2 1 / 2 0 4 7 0 6、G B 2 5 9 4 9 3 1 および W O 2 0 1 6 / 0 1 0 7 3 1 は、除草作用があるとされているヘテロアリールオキシベンゼン類を記載する文献の一部である。W O 2 0 2 0 / 0 0 2 0 8 9 および W O 2 0 2 2 / 0 0 2 8 3 8 は、除草作用があるとされているヘテロアリールオキシピリジン類を記載している。W O 2 0 2 0 / 1 9 3 4 7 4 は、除草作用があるとされている 2 - ヘテロアリールアミノベンゼン類を記載している。

【0 0 0 5】

50

対照的に、置換 2-C-アジンまたはその塩は、まだ、活性除草性成分として記載されていない。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0006】

【特許文献 1】 オーストラリア国特許第 5 3 5 6 3 7 号

【特許文献 2】 欧州特許第 8 1 9 2 号

【特許文献 3】 欧州特許第 6 1 9 1 3 号

【特許文献 4】 特許第 6 1 2 3 6 7 6 6 号

【特許文献 5】 国際公開第 2 0 1 6 / 1 9 6 6 0 6 号

10

【特許文献 6】 国際公開第 2 0 2 1 / 2 0 4 7 0 6 号

【特許文献 7】 イギリス国特許第 2 5 9 4 9 3 1 号

【特許文献 8】 国際公開第 2 0 1 6 / 0 1 0 7 3 1 号

【特許文献 9】 国際公開第 2 0 2 0 / 0 0 2 0 8 9 号

【特許文献 10】 国際公開第 2 0 2 2 / 0 0 2 8 3 8 号

【特許文献 11】 国際公開第 2 0 2 0 / 1 9 3 4 7 4 号

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0007】

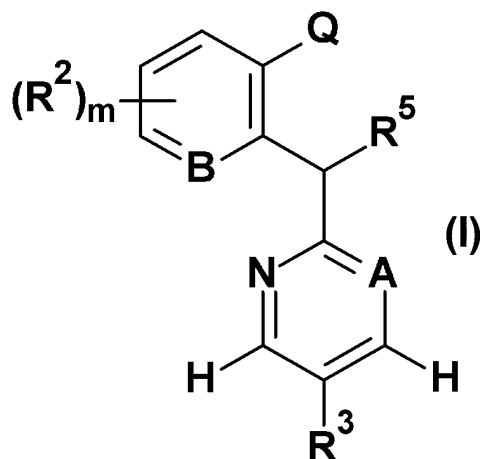
驚くべきことに、特定の置換 2-C-アジンまたはその塩が、活性除草性成分として特に適していることが今回見出された。

20

【0008】

したがって、本発明は、一般式 (I) :

【化 1】



30

〔式中、

40

A は、窒素または C R¹ であり、

R¹ は、水素、C N またはハロゲンであり、

B は、C H、C R² または N であり、

Q は、Y - (C₂ - C₆) - ハロアルキルであり、ここで、Y は、直接結合、酸素、S (O)_n、C O または O S O₂ を表し、または

Q は、Z - アリールまたは Z - ヘテロアリールであり、ここで、アリールは、R⁴ の群から独立して選択される 1 ~ 5 個の置換基によって置換されており、ヘテロアリールは、R⁴ の群から独立して選択される 2 個までの置換基によって置換されており、および Z は、直接結合、O、S (O)_n または C H₂ を表し、

R² は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、(C₁ - C₄) - アルキル、

50

($C_1 - C_4$) - ハロアルキル、シクロプロピル、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_4$) - ハロアルコキシまたは($C_1 - C_4$) - アルキル - $S(O)_n$ - であり、

m は、0、1、2 または 3 であり、

n は、0、1 または 2 であり、

R^3 は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_4$) - ハロアルキル、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_2$) - ハロアルコキシまたは($C_1 - C_4$) - アルキル - $S(O)_n$ - であり、

ただし、 A が CR^1 である場合、 R^3 は水素であってはならず、

R^4 は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、($C_1 - C_4$) - アルキル、($C_1 - C_8$) - ハロアルキル、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、($C_1 - C_2$) - ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) - アルコキシメチル、($C_1 - C_4$) - アルキル - $S(O)_n$ - であり、

および

R^5 は、水素または CN である]

の置換 2 - C - アジンまたはその塩を提供する。

【0009】

一般式 (I) の化合物は、好適な無機酸または有機酸、例えば 鉱酸、例えば HCl 、 HBr 、 H_2SO_4 、 H_3PO_4 または HNO_3 、または有機酸、例えばカルボン酸、例えばギ酸、酢酸、プロピオン酸、シュウ酸、乳酸またはサリチル酸またはスルホン酸、例えば p - トルエンスルホン酸を塩基性基、例えばアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ピペリジノ、モルホリノまたはピリジノに付加することによって塩を形成することができる。これらの塩には、酸の共役塩基がアニオンとして含まれる。脱プロトン化形態の好適な置換基、例えばスルホン酸、特にスルホンアミドまたはカルボン酸は、それ自体プロトン化可能なアミノ基などの基と内部塩を形成することができる。塩はまた、一般式 (I) の化合物に対する塩基の作用によって形成され得る。好適な塩基は例えば、有機アミン、例えばトリアルキルアミン、モルホリン、ピペリジンおよびピリジン、ならびにアンモニウム、アルカリ金属またはアルカリ土類金属の水酸化物、炭酸塩および炭酸水素塩、特に水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウムおよび炭酸水素カリウムである。これらの塩は、酸性水素が農業上好適なカチオン、例えば金属塩、特にアルカリ金属塩またはアルカリ土類金属塩、特にナトリウムおよびカリウム塩、またはアンモニウム塩、有機アミンとの塩または第四級アンモニウム塩、例えば式 $[NR^aR^bR^cR^d]^+$ のカチオン (式中、 $R^a \sim R^d$ はそれぞれ独立して、有機基、特にアルキル、アリール、アリールアルキルまたはアルキルアリールである) で置き換えられている化合物である。アルキルスルホニウムおよびアルキルスルホキソニウム塩、例えば ($C_1 - C_4$) - トリアルキルスルホニウムおよび ($C_1 - C_4$) - トリアルキルスルホキソニウム塩も有用である。

【0010】

一般式 (I) の本発明の置換 2 - C - アジンは、外部条件、例えば pH 、溶媒および温度に応じて、種々の互変異性体構造で存在することができ、その全てが一般式 (I) によって包含される。

【0011】

本発明に従って使用される式 (I) の化合物、およびその塩は、以下において、「一般式 (I) の化合物」と称される。

【発明を実施するための形態】

【0012】

本発明は、より好ましくは、一般式 (I) (式中、

A は、窒素または CR^1 であり、

R^1 は、水素、 CN またはハロゲンであり、

B は、 CH 、 CR^2 または N であり、

Q は、 $Y - (C_3 - C_5) -$ ハロアルキルであり、ここで、 Y は、直接結合、酸素、 $S(O)_n$ 、 CO または OSO_2 を表し、または

10

20

30

40

50

Qは、Z-アリーールまたはZ-ヘテロアリーールであり、ここで、アリーールは、 R^4 の群から独立して選択される1～3個の置換基によって置換されており、ヘテロアリーールは、 R^4 の群から独立して選択される2個までの置換基によって置換されており、およびZは、直接結合、O、S(O)_nまたはCH₂を表し、

R^2 は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、シクロプロピル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシまたは(C₁-C₄)-アルキル-S(O)_nであり、

mは、0、1、2または3であり、

nは、0、1または2であり、

R^3 は、水素、ハロゲン、シアノ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシまたは(C₁-C₂)-ハロアルコキシであり、ただし、AがCR¹である場合、 R^3 は水素であってはならず、

R^4 は、ハロゲン、シアノ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₈)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシメチルであり、

および

R^5 は、水素またはCNである)の化合物を提供する。

【0013】

本発明は、特に好ましくは一般式(I)〔式中、

Aは、窒素またはCR¹であり、

R^1 は、水素、シアノ、フッ素または塩素であり、

Bは、CH、CR²またはNであり、

Qは、Y-(C₃-C₅)-ハロアルキルであり、ここで、Yは、直接結合、酸素、S、COまたはOSO₂を表し、または

Qは、Z-アリーールまたはZ-ヘテロアリーールであり、ここで、アリーールは、 R^4 の群から独立して選択される1または2個の置換基によって置換されており、ヘテロアリーールは、 R^4 の群から独立して選択される2個までの置換基によって置換されており、およびZは、直接結合、O、SまたはCH₂を表し、

R^2 は、独立して、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、CF₃またはメトキシであり、

mは、0、1または2であり、

R^3 は、水素、塩素、臭素、フッ素、シアノ、メチル、CF₃、メトキシまたはCHF₂Oであり、

ただし、AがCR¹である場合、 R^3 は水素であってはならず、

R^4 は、フッ素、塩素、メチル、CHF₂、CF₃またはメトキシメチルであり、

および

R^5 は、水素またはCNである)の化合物を提供する。

【0014】

本発明は、さらに好ましくは一般式(I)〔式中、

Aは、窒素またはCR¹であり、

R^1 は、水素、シアノ、フッ素または塩素であり、

Bは、CH、CR²またはNであり、

Qは、Y-(C₃-C₅)-ハロアルキルであり、ここで、Yは、直接結合、酸素、S、COまたはOSO₂を表し、または

Qは、Z-アリーールまたはZ-ヘテロアリーールであり、ここで、アリーールは、 R^4 の群から独立して選択される1または2個の置換基によって置換されており、ヘテロアリーールは、 R^4 の群から独立して選択される2個までの置換基によって置換されており、およびZは、直接結合、O、SまたはCH₂を表し、

R^2 は、独立して、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、CF₃またはメトキシであり、

mは、0、1または2であり、

10

20

30

40

50

R^3 は、水素、塩素、臭素、フッ素、シアノ、メチル、 CF_3 、メトキシまたは CHF_2O であり、

ただし、 A が CR^1 である場合、 R^3 は水素であってはならず、

R^4 は、フッ素、塩素、メチル、 CHF_2 、 CF_3 またはメトキシメチルであり、
および

R^5 は、水素または CN である) の化合物を提供する。

【0015】

本発明は、さらに好ましくは一般式 (I) (式中、

A は、窒素、 CH 、 CCN または CF であり、

B は、 CH であり、

Q は、 $(CH_2)_3CF_3$ 、 $(CH_2)_4CF_3$ 、 $S(CH_2)_3CF_3$ 、 $S(CH_2)_3Cl$ 、 $SO(CH_2)_3Cl$ 、 $SO(CH_2)_2CF_3$ 、 $SO(CH_2)_3CF_3$ 、 $SO_2(CH_2)_3CF_3$ 、 $O(CH_2)_3CF_3$ 、 $C(O)(CH_2)_3CF_3$ 、 $OSO_2(CH_2)_2CF_3$ 、 $OSO_2(CH_2)_3CF_3$ 、 $OSO_2(CH_2)_3Cl$ 、4-フルオロベンジル、4-クロロフェニル、3, 4-ジフルオロフェニル、4-フルオロフェノキシ、5- Cl -ピリミジン-2-オキシ、5- F -ピリミジン-2-オキシ、5- Cl -3- F -ピリジン-2-オキシ、4-フルオロフェニルスルファニル、2, 4- Cl_2 -フェニルスルホニル、2, 4- Cl_2 -フェニルスルファニル、2, 4- Cl_2 -フェニルスルフィニル、3-(CHF_2)-イソオキサゾール-5-イル、5-(CHF_2)-イソオキサゾール-3-イル、1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、5-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、5-(CHF_2)-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、5-(CF_3)-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、5- Cl -ピリミジン-2-イルスルファニル、5- Cl -ピリミジン-2-イルスルフィニル、5- Cl -ピリミジン-2-イルスルホニル、5- F -ピリミジン-2-イルスルファニル、4-(CF_3)-ピラゾール-1-イル、4- Cl -ピラゾール-1-イルメチル、4- Br -ピラゾール-1-イルメチルまたは 4-(CF_3)-ピラゾール-1-イルメチルであり、

R^2 は、独立して、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、 CF_3 またはメトキシであり、

m は、0、1 または 2 であり、

R^3 は、塩素、臭素またはフッ素であり、

および

R^5 は、水素または CN である) の化合物を提供する。

【0016】

本発明は、さらに好ましくは一般式 (I) (式中、

A は、窒素、 CH または CF であり、

B は、 CH であり、

Q は、 $(CH_2)_3CF_3$ 、 $S(CH_2)_3CF_3$ 、 $SO(CH_2)_3CF_3$ 、 $O(CH_2)_3CF_3$ 、 $OSO_2(CH_2)_3CF_3$ 、 $OSO_2(CH_2)_3Cl$ 、4-フルオロベンジル、3, 4-ジフルオロフェニル、4-フルオロフェノキシ、4-フルオロフェニルスルファニル、2, 4- Cl_2 -フェニルスルファニル、4-(CF_3)-ピラゾール-1-イル、5- Cl -ピリミジン-2-オキシ、5- F -ピリミジン-2-オキシ、5- Cl -3- F -ピリジン-2-オキシ、3-(CHF_2)-イソオキサゾール-5-イルまたは 5-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イルであり、

R^2 は、独立して、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、 CF_3 またはメトキシであり、

m は、0、1 または 2 であり、

R^3 は、塩素、臭素またはフッ素であり、

および

R^5 は、水素または CN である) の化合物を提供する。

【0017】

一般的な用語にまたは好ましい範囲内で上に列挙されたラジカルの定義は、一般式（I）の最終生成物およびそれぞれの場合に調製に必要な出発物質または中間体の両方に適用される。これらのラジカルの定義は、所望に応じて、すなわち、与えられた好ましい範囲の間の組み合わせを含めて、互いに組み合わせることができる。

【0018】

主により高い除草活性、より良好な選択性および／またはより良好な調製可能性の理由から、特に興味深いのは、個々のラジカルが既に特定されたか、または以下に特定される好ましい意味の1つを有するか、または特に既に特定されたかまたは以下に特定される好ましい意味の1つ以上が組み合わさって現れる、記載されている一般式（I）の本発明の化合物またはその塩、またはその本発明の使用である。

10

【0019】

本発明の化合物に関して、上記および下記で使用される用語を説明する。これらは、当業者によく知られており、特に、以下に説明される定義を有する：

【0020】

別様に定義されない限り、化学基の名称は一般に、分子の骨格または残部への結合は、最後に言及した関連する化学基の構造要素を介する、すなわち、例えば、 (C_1-C_4) －アルコキシの場合、酸素原子を介し、 (C_1-C_4) －アルキル－S(O)_n－の場合、硫黄原子を介し、および (C_1-C_4) －アルコキシメチルの場合、メチル基の炭素原子を介するように理解されるべきである。

20

【0021】

用語「ハロゲン」は例えば、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を表す。この用語がラジカルに使用される場合、「ハロゲン」は例えば、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素原子を表す。

【0022】

本明細書で例示的に言及される「 (C_1-C_4) －アルキル」という表現は炭素原子について述べられた範囲に従う1～4個の炭素原子を有する直鎖または分枝鎖アルキルについての簡潔な表記であり、すなわち、メチル、エチル、1－プロピル、2－プロピル、1－ブチル、2－ブチル、2－メチルプロピルまたはtert－ブチルラジカルを包含する。より広い特定の範囲の炭素原子を有する一般的なアルキル基、例えば「 (C_2-C_6) －アルキル」は対応して、より多数の炭素原子を有する直鎖または分枝アルキルラジカル、すなわち、本発明によれば、5および6個の炭素原子を有するアルキルラジカルも包含する。

30

【0023】

「ハロアルキル」は、同一または異なったハロゲン原子で部分的にまたは完全に置換されたアルキル、例えばモノハロアルキル、例えば CH_2CH_2Cl 、 CH_2CH_2Br 、 $CHClCH_3$ 、 CH_2Cl 、 CH_2F 、 $CH_2CH_2CF_3$ ；ペルハロアルキル、例えば CCl_3 、 $CClF_2$ 、 $CFCl_2$ 、 CF_2CClF_2 、 $CF_2CClF_2CF_3$ ；ポリハロアルキル、例えば CH_2CHFCl 、 CF_2CClFH 、 CF_2CBrFH 、 CH_2CF_3 を表し；用語ペルハロアルキルはまた、用語ペルフルオロアルキルを包含する。

40

【0024】

「アルコキシ」は、酸素原子を介して結合したアルキルラジカル、例えば（ただしこれに限定されるわけではないが） (C_1-C_4) －アルコキシ、例えばメトキシ、エトキシ、プロポキシ、1－メチルエトキシ、ブトキシ、1－メチルプロポキシ、2－メチルプロポキシおよび1，1－ジメチルエトキシを表す。

【0025】

ハロアルコキシは、例えば、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 OCH_2F 、 OCF_2CF_3 、 OCH_2CF_3 および OCH_2CH_2Cl である。

【0026】

用語「アリール」は、好ましくは6～14個、特に6～10個の環炭素原子を有する任

50

意に置換された単環式、二環式または多環式芳香族系、例えばフェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニルなど、好ましくはフェニルを表す。

【0027】

基礎構造が、ラジカルのリスト（＝群）または一般的に定義されたラジカル群からの「1つ以上のラジカル」によって置換される場合、これは、それぞれの場合において、複数の同一のおよび／または構造的に異なるラジカルによる同時置換を含む。

【0028】

本発明によれば、「ヘテロアリール」という表現は、ヘテロ芳香族化合物、すなわち完全に不飽和の芳香族複素環式化合物、好ましくは5～7員環で、1～4個、好ましくは1または2個の同一または異なるヘテロ原子、好ましくはO、SまたはNを有するものを表す。本発明のヘテロアリールは例えば、1H-ピロール-1-イル；1H-ピロール-2-イル；1H-ピロール-3-イル；フラン-2-イル；フラン-3-イル；チエン-2-イル；チエン-3-イル、1H-イミダゾール-1-イル；1H-イミダゾール-2-イル；1H-イミダゾール-4-イル；1H-イミダゾール-5-イル；1H-ピラゾール-1-イル；1H-ピラゾール-3-イル；1H-ピラゾール-4-イル；1H-ピラゾール-5-イル、1H-1, 2, 3-トリアゾール-1-イル、1H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル、1H-1, 2, 3-トリアゾール-5-イル、2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル、2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル、1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル、4H-1, 2, 4-トリアゾール-4-イル、1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル、1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル、1, 2, 3-オキサジアゾール-4-イル、1, 2, 3-オキサジアゾール-5-イル、1, 2, 5-オキサジアゾール-3-イル、アゼピニル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、ピラジン-2-イル、ピラジン-3-イル、ピリミジン-2-イル、ピリミジン-4-イル、ピリミジン-5-イル、ピリダジン-3-イル、ピリダジン-4-イル、1, 3, 5-トリアジン-2-イル、1, 2, 4-トリアジン-3-イル、1, 2, 4-トリアジン-5-イル、1, 2, 4-トリアジン-6-イル、1, 2, 3-トリアジン-4-イル、1, 2, 3-トリアジン-5-イル、1, 2, 4-、1, 3, 2-、1, 3, 6-および1, 2, 6-オキサジニル、イソオキサゾール-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、イソオキサゾール-5-イル、1, 3-オキサゾール-2-イル、1, 3-オキサゾール-4-イル、1, 3-オキサゾール-5-イル、イソチアゾール-3-イル、イソチアゾール-4-イル、イソチアゾール-5-イル、1, 3-チアゾール-2-イル、1, 3-チアゾール-4-イル、1, 3-チアゾール-5-イル、オキセピニル、チエピニル、1, 2, 4-トリアゾロニル (triazolonyl) および1, 2, 4-ジアゼピニル、2H-1, 2, 3, 4-テトラゾール-5-イル、1H-1, 2, 3, 4-テトラゾール-5-イル、1, 2, 3, 4-オキサトリアゾール-5-イル、1, 2, 3, 4-チアトリアゾール-5-イル、1, 2, 3, 5-オキサトリアゾール-4-イル、1, 2, 3, 5-チアトリアゾール-4-イルである。本発明のヘテロアリール基はまた、1つ以上の同一または異なるラジカルによって置換されていてもよい。2個の隣接する炭素原子がさらなる芳香族環の一部である場合、系は、ベンゾ縮合または縮合多環化されたヘテロ芳香族などの縮合ヘテロ芳香族系である。好ましい例は、キノリン類（例えば、キノリン-2-イル、キノリン-3-イル、キノリン-4-イル、キノリン-5-イル、キノリン-6-イル、キノリン-7-イル、キノリン-8-イル）；イソキノリン類（例えば、イソキノリン-1-イル、イソキノリン-3-イル、イソキノリン-4-イル、イソキノリン-5-イル、イソキノリン-6-イル、イソキノリン-7-イル、イソキノリン-8-イル）；キノキサリン；キナゾリン；シンノリン；1, 5-ナフチリジン；1, 6-ナフチリジン；1, 7-ナフチリジン；1, 8-ナフチリジン；2, 6-ナフチリジン；2, 7-ナフチリジン；フタラジン；ピリドピラジン；ピリドピリミジン；ピリドピリダジン；プテリジン；ピリミドピリミジンである。ヘテロアリールの例はまた、1H-インドール-1-イル、1H-インドール-2-イル、1H-インド

ール-3-イル、1H-インドール-4-イル、1H-インドール-5-イル、1H-インドール-6-イル、1H-インドール-7-イル、1-ベンゾフラン-2-イル、1-ベンゾフラン-3-イル、1-ベンゾフラン-4-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、1-ベンゾフラン-6-イル、1-ベンゾフラン-7-イル、1-ベンゾチオフエン-2-イル、1-ベンゾチオフエン-3-イル、1-ベンゾチオフエン-4-イル、1-ベンゾチオフエン-5-イル、1-ベンゾチオフエン-6-イル、1-ベンゾチオフエン-7-イル、1H-インダゾール-1-イル、1H-インダゾール-3-イル、1H-インダゾール-4-イル、1H-インダゾール-5-イル、1H-インダゾール-6-イル、1H-インダゾール-7-イル、2H-インダゾール-2-イル、2H-インダゾール-3-イル、2H-インダゾール-4-イル、2H-インダゾール-5-イル、2H-インダゾール-6-イル、2H-インダゾール-7-イル、2H-イソインドール-2-イル、2H-イソインドール-1-イル、2H-イソインドール-3-イル、2H-イソインドール-4-イル、2H-イソインドール-5-イル、2H-イソインドール-6-イル、2H-イソインドール-7-イル、1H-ベンゾイミダゾール-1-イル、1H-ベンゾイミダゾール-2-イル、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル、1H-ベンゾイミダゾール-6-イル、1H-ベンゾイミダゾール-7-イル、1,3-ベンゾオキサゾール-2-イル、1,3-ベンゾオキサゾール-4-イル、1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル、1,3-ベンゾオキサゾール-6-イル、1,3-ベンゾオキサゾール-7-イル、1,3-ベンゾチアゾール-2-イル、1,3-ベンゾチアゾール-4-イル、1,3-ベンゾチアゾール-5-イル、1,3-ベンゾチアゾール-6-イル、1,3-ベンゾチアゾール-7-イル、1,2-ベンゾイソオキサゾール-3-イル、1,2-ベンゾイソオキサゾール-4-イル、1,2-ベンゾイソオキサゾール-5-イル、1,2-ベンゾイソオキサゾール-6-イル、1,2-ベンゾイソオキサゾール-7-イル、1,2-ベンゾイソチアゾール-3-イル、1,2-ベンゾイソチアゾール-4-イル、1,2-ベンゾイソチアゾール-5-イル、1,2-ベンゾイソチアゾール-6-イル、1,2-ベンゾイソチアゾール-7-イルの群からの5員または6員のベンゾ縮合環である。

10

20

【0029】

化合物が、水素シフトを介して、その構造が一般式(I)によって形式的に包含されない互変異性体を形成することができる場合、これらの互変異性体はそれにもかかわらず、特定の互変異性体が考慮されていない限り、一般式(I)の本発明の化合物の定義によって包含される。例えば、多くのカルボニル化合物はケト形態およびエノール形態の両方で存在することができ、両方の形態は、一般式(I)の化合物の定義に包含される。

30

【0030】

置換基の性質およびそれらが結合する様式に応じて、一般式(I)の化合物は立体異性体として存在し得る。エナンチオマー、ジアステレオマー、ZおよびE異性体などの、その特定の三次元形態によって定義される可能な立体異性体は、全て一般式(I)により包含される。例えば、1つ以上のアルケニル基が存在する場合、ジアステレオマー(ZおよびE異性体)が生じ得る。例えば、1個以上の不斉炭素原子が存在する場合、エナンチオマーおよびジアステレオマーが生じ得る。立体異性体は調製において得られた混合物から、慣習的な分離方法によって得ることができる。クロマトグラフィー分離は、エナンチオマー過剰率またはジアステレオマー過剰率を見出すために分析スケールで、または生物学的試験のための試験試料を製造するために分取スケールで実施することができる。同様に、光学活性な出発物質および/または助剤を使用する立体選択的反応を使用することによって、立体異性体を選択的に調製することが可能である。したがって、本発明はまた、一般式(I)によって包含されるが、それらの特定の立体異性体形態では示されていない全ての立体異性体、およびそれらの混合物に関する。

40

【0031】

化合物が固体として得られる場合、精製は、再結晶または消化によって行うこともできる。一般式(I)の個々の化合物が以下に記載される経路によって満足のいく様式で得ら

50

れない場合、それらは、一般式（Ⅰ）の他の化合物の誘導体化によって調製することができる。

【0032】

一般式（Ⅰ）の化合物の好適な単離方法、精製方法および立体異性体を分離するための方法は、類似の事例から当業者に一般に知られている方法であり、例えば、物理的方法、例えば結晶化、クロマトグラフィー法、特にカラムクロマトグラフィーおよびHPLC（高圧液体クロマトグラフィー）、場合により減圧下での蒸留、抽出および他の方法により、残存する任意の混合物は一般に、クロマトグラフィー分離によって、例えばキラル固相上で分離することができる。分取量または工業規模に適した方法は例えば、光学活性酸を用いてジアステレオマー混合物から得ることができるジアステレオマー塩の結晶化などの方法であり、適切な場合には、酸性基が存在する場合には、光学活性塩基を用いる。

10

【0033】

本発明はまた、一般式（Ⅰ）の本発明の化合物の製造方法を特許請求する。

【0034】

一般式（Ⅰ）の本発明の化合物は、とりわけ、公知の方法を用いて調製することができる。使用され、試験される合成経路は、市販されているか、または容易に調製可能なビルディングブロックから進行する。以下のスキームにおいて、一般式（Ⅰ）のA、B、Q、R²、R³およびmの部分、上記で定義された意味を有し、例示されていない限り、限定されない定義が与えられる。

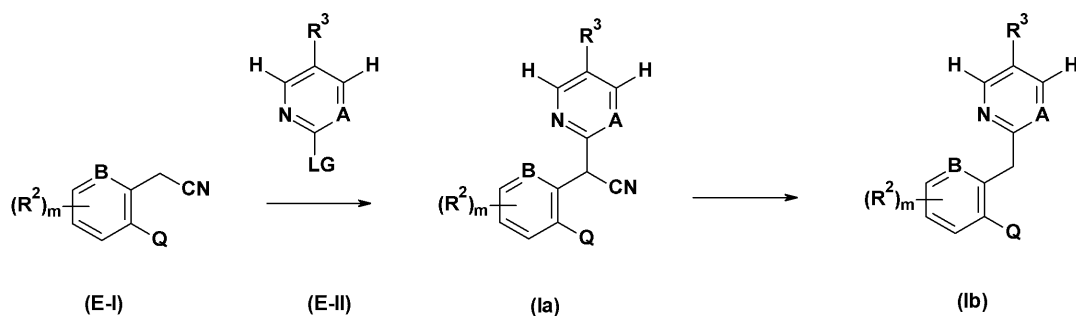
20

【0035】

本発明の化合物は例えば、以下のスキーム1に特定される方法によって調製することができる。

スキーム1

【化2】



30

【0036】

一般式（Ⅰa）のピリ（ミ）ジンは、対応するアセトニトリル（E-I）を、ピリ（ミ）ジン（E-II）（式中、LGは脱離基である）と、例えば塩基の存在下でカップリングさせることによって調製することができる。この目的のために必要とされる塩基は例えば、アルカリ金属（例えば、ナトリウムまたはカリウム）の炭酸塩またはアルカリ金属（例えば、ナトリウム）の水素化物であり得る。反応は一般に、有機溶媒、例えばジオキサン、ジメチルスルホキシドまたはジメチルホルムアミド中、0℃と溶媒の沸点との間の温度で行われる。

40

【0037】

一般式（Ⅰb）のピリ（ミ）ジンは、例えば、対応するアセトニトリル（Ⅰa）の脱炭酸加水分解によって製造することができる。対応する条件は、例えば、沸点まで加熱した水性酸（例えば塩酸）である。

【0038】

一般式（E-I）のアセトニトリルは文献から公知であり、例えば、*Helvetica Chimica Acta*（2003），86（2），343-360、*Angewandte Chemie, International Edition*（2011

50

), 50 (19), 4470-4474に記載の方法、および類似の方法によって調製することができる。

【0039】

一般式(I)の本発明の化合物の選択された詳細な合成例を以下に示す。以下の項に記載された化学的実施例について報告された ^1H NMR、 ^{13}C NMR、および ^{19}F NMR分光データ(^1H NMRでは400 MHz、 ^{13}C NMRでは150 MHz、 ^{19}F NMRでは375 MHz、溶媒 CDCl_3 、 CD_3OD または $d_6\text{-DMSO}$ 、内部標準：テトラメチルシラン $\delta=0.00\text{ ppm}$)は、Brukerの装置で得られ、列挙されたシグナルは以下に示される意味を有する：b=ブロード；s=シングレット、d=ダブルット、t=トリプレット、dd=ダブルットのダブルット、ddd=ダブルットのダブルットのダブルット、m=マルチプレット、q=カルテット、quint=クインテット、sext=セクステット、sept=セプテット、dq=カルテットのダブルット、dt=トリプレットのダブルット。ジアステレオマー混合物の場合、報告されているのは、2つのジアステレオマーのそれぞれについての有意なシグナルまたは主ジアステレオマーの特徴的なシグナルのいずれかである。化学基に使用される略語は例えば、以下の意味を有する：Me= CH_3 、Et= CH_2CH_3 、t-Hex= $\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、t-Bu= $\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 、n-Bu=非分岐ブチル、n-Pr=非分岐プロピル、i-Pr=分岐プロピル、c-Pr=シクロプロピル、c-Hex=シクロヘキシル。

10

20

【実施例】

【0040】

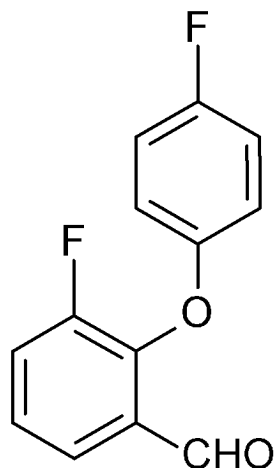
合成実施例：

表実施例番号1-34：(5-クロロピリミジン-2-イル) [3-フルオロ-2-(4-フルオロフェノキシ)フェニル] アセトニトリル

【0041】

合成段階1：3-フルオロ-2-(4-フルオロフェノキシ)ベンズアルデヒド

【化3】



30

40

【0042】

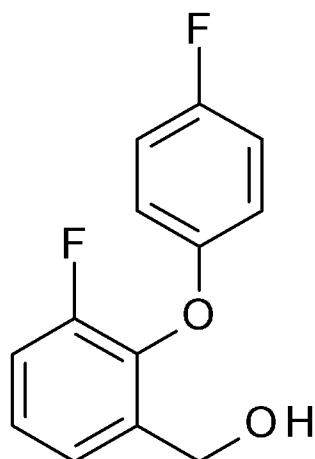
30 mlのDMF中の2.0 gの2,3-ジフルオロベンズアルデヒド(14.1 mmol、1.0当量)、2.37 gの2-フルオロフェノール(21.1 mmol、1.5当量)および3.89 gの炭酸カリウム(28.1 mmol、2.0当量)の溶液を、100℃で3時間攪拌した。その後、50 mlのエーテルで希釈し、2 N水酸化ナトリウム溶液(30 ml×2)および飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーで精製した。収量は2.82 g(85%)であった。

50

$^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, CDCl_3): 10.35 (s, 1H); 7.75 (m, 1H); 7.43 (m, 1H); 7.32 (m, 1H); 7.01 (m, 2H); 6.91 (m, 2H).

【0043】

合成段階2：3-フルオロ-2-(4-フルオロフェノキシ)ベンジルアルコール
【化4】



10

【0044】

44 ml の THF と 22 ml の MeOH の混合物中の 2.8 g の 3-フルオロ-2-(4-フルオロフェノキシ)ベンズアルデヒド (12 mmol、1.0 当量) に 0.91 g の水素化ホウ素ナトリウム (24 mmol、2.0 当量) を加え、混合物を室温で 3 時間撹拌した。続いて、溶液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を減圧下で濃縮し、残渣をジクロロメタンに溶解し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮した。得られた生成物は、それ以上精製せずに使用した。収量は、2.77 g (98% 粗生成物) であった。

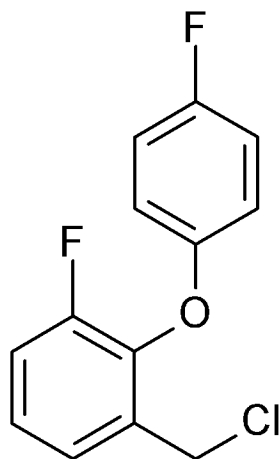
20

$^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, CDCl_3): 7.30 (m, 1H); 7.23 (m, 1H); 7.13 (m, 1H); 6.97 (m, 2H); 6.84 (m, 2H); 4.69 (s, 2H); 1.79 (bs, 1H)

【0045】

合成段階3：3-フルオロ-2-(4-フルオロフェノキシ)ベンジルクロリド
【化5】

30



40

【0046】

18 ml のトルエン中の 2.70 g の 3-フルオロ-2-(4-フルオロフェノキシ)ベンジルアルコール (11.4 mmol、1.0 当量) の溶液に、1.0 ml の塩化チオニルを加え、混合物を室温で 5 時間撹拌した。その後、水を加え、ジクロロメタンで抽出

50

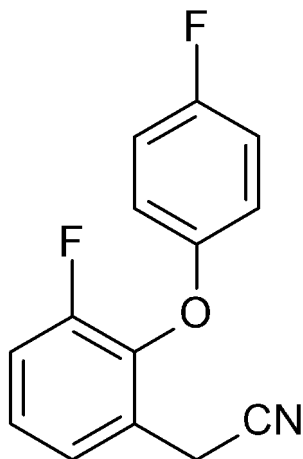
した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮した。得られた生成物は、それ以上精製せずに使用した。収量は、3.29 g (100%粗生成物)であった。

$^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, CDCl_3): 7.31-7.12 (m, 3H); 6.98 (m, 2H); 6.87 (m, 2H); 4.60 (s, 2H)

【0047】

合成段階4: (3-フルオロ-2-(4-フルオロフェノキシ)フェニル)アセトニトリル

【化6】



10

20

【0048】

3.2 g of 3-fluoro-2-(4-fluorophenoxy)benzyl chloride (12.6 mmol, 1.0 equiv) and 982 mg of potassium cyanide (15.1 mmol, 1.2 equiv) in 5 mL of water and 25 mL of ethanol were heated to reflux for 6 hours. After concentration, the residue was dissolved in dichloromethane. The organic phase was dried with sodium sulfate, concentrated under reduced pressure, and the residue was purified by column chromatography. The yield was 1.46 g (47%)

$^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, CDCl_3): 7.33 (m, 1H); 7.26 (m, 1H); 7.18 (m, 1H); 6.99 (m, 2H); 6.83 (m, 2H); 3.72 (s, 2H)

30

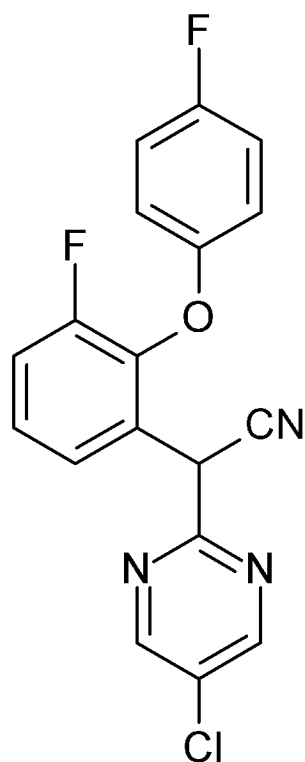
【0049】

合成段階5: (5-chloropyrimidin-2-yl) [(3-fluoro-2-(4-fluorophenoxy)phenyl)acetonitrile]

40

50

【化 7】



10

20

【0050】

15 ml の THF 中の 500 mg の (3-フルオロ-2-(4-フルオロフェノキシ)フェニル)アセトニトリル (2.0 mmol、1.0 当量) に 179 mg の水素化ナトリウム (60%) (4.49 mmol、2.2 当量) を加え、混合物を室温で 30 分間攪拌した。続いて、365 mg の 2,5-ジクロロピリミジン (2.45 mmol、1.2 当量) を加え、混合物を室温で一晩攪拌した。その後、混合物に 2 N 塩酸を加え、ジクロロメタンで抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮し、残渣をカラムクロマトグラフィーで精製した。収量は、631 mg (87%) であった。

30

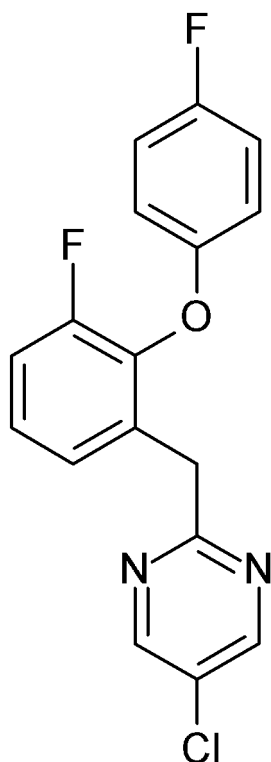
【0051】

表実施例番号 1-35 : 5-クロロ-2-[3-フルオロ-2-(4-フルオロフェノキシ)ベンジル]ピリミジン

40

50

【化 8】



10

20

【0052】

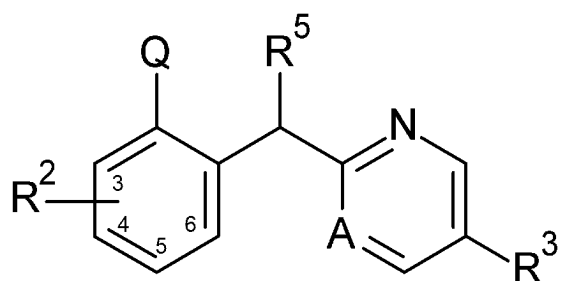
6 ml の氷酢酸と 2 ml の濃塩酸の混合物中の 530 mg の（5-クロロピリミジン-2-イル）〔3-フルオロ-2-（4-フルオロフェノキシ）フェニル〕アセトニトリル（1.48 mmol）を 100℃で 8 時間攪拌した。その後、混合物を濃縮し、残渣をカラムクロマトグラフィーで精製した。収量は、200 mg（41%）であった。

【0053】

上記で引用され、適切な時点で列挙された調製実施例と同様に、以下に特定し、表 1 に示す一般式の化合物が得られる。

30

【化 9】



40

【0054】

表 1

50

【表 1】

実施例番号	R ²	R ³	R ⁵	A	Q
1-1	H	Cl	H	N	(CH ₂) ₃ CF ₃
1-2	H	Cl	H	N	CH ₂ CF ₄
1-3	H	F	H	N	(CH ₂) ₃ CF ₃
1-4	H	Cl	H	N	S(CH ₂) ₃ CF ₃
1-5	H	Cl	H	N	SO(CH ₂) ₃ CF ₃
1-6	H	Cl	H	N	SO ₂ (CH ₂) ₃ CF ₃
1-7	H	F	H	N	S(CH ₂) ₃ CF ₃
1-8	H	Cl	H	N	O(CH ₂) ₃ CF ₃
1-9	H	Cl	H	N	C(O)(CH ₂) ₃ CF ₃
1-10	H	Cl	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₃ CF ₃
1-11	H	F	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₃ CF ₃
1-12	H	Cl	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃
1-13	H	F	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃
1-14	3-F	Cl	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₃ CF ₃
1-15	3-F	F	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₃ CF ₃
1-16	3-F	Cl	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃
1-17	3-F	F	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃
1-18	3-Cl	Cl	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₃ CF ₃
1-19	3-Cl	F	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₃ CF ₃
1-20	3-Cl	Cl	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃
1-21	3-Cl	F	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃
1-22	3-F	Cl	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₃ C ₂ F ₅

実施例番号	R ²	R ³	R ⁵	A	Q
1-23	H	Cl	H	N	4-フルオロベンジル
1-24	H	Cl	H	N	4-フルオロフェニル
1-25	H	Cl	H	N	4-クロロフェニル
1-26	H	Cl	H	N	3,4-ジフルオロフェニル
1-27	H	F	H	N	3,4-ジフルオロフェニル
1-28	H	Cl	CN	N	4-フルオロフェノキシ
1-29	H	Cl	H	N	4-フルオロフェノキシ
1-30	3-Me	Cl	CN	N	4-フルオロフェノキシ
1-31	3-Me	Cl	H	N	4-フルオロフェノキシ
1-32	3-MeO	Cl	CN	N	4-フルオロフェノキシ
1-33	3-MeO	Cl	H	N	4-フルオロフェノキシ
1-34	3-F	Cl	CN	N	4-フルオロフェノキシ
1-35	3-F	Cl	H	N	4-フルオロフェノキシ
1-36	3-Br	Cl	CN	N	4-フルオロフェノキシ
1-37	3-Br	Cl	H	N	4-フルオロフェノキシ
1-38	3-CN	Cl	H	N	4-フルオロフェノキシ
1-39	3-CF ₃	Cl	CN	N	4-フルオロフェノキシ
1-40	3-CF ₃	Cl	H	N	4-フルオロフェノキシ
1-41	H	Cl	CN	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル
1-42	H	Cl	H	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル
1-43	3-Br	Cl	CN	N	4-(CF ₃)ピラゾール-1-イル
1-44	3-Br	Cl	H	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル
1-45	3-CN	Cl	H	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル
1-46	3-F	Cl	CN	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル
1-47	3-F	Cl	H	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル
1-48	3-Me	Cl	CN	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル

10

20

30

40

50

実施例番号	R ²	R ³	R ⁵	A	Q
1-49	3-Me	Cl	H	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル
1-50	H	Cl	H	N	5-Cl-ピリミジン-2-オキシ
1-51	6-F	Cl	H	N	5-Cl-ピリミジン-2-オキシ
1-52	6-F	Cl	H	N	5-F-ピリミジン-2-オキシ
1-53	6-Br	Cl	H	N	5-Cl-ピリミジン-2-オキシ
1-54	6-Br	Cl	H	N	5-F-ピリミジン-2-オキシ
1-55	6-Br	Cl	H	N	5-Cl-3-F-ピリジン-2-オキシ
1-56	6-Cl	Cl	H	N	5-Cl-ピリミジン-2-オキシ
1-57	6-Cl	Cl	H	N	5-F-ピリミジン-2-オキシ
1-58	6-Cl	Cl	H	N	5-Cl-3-F-ピリジン-2-オキシ
1-59	6-CN	Cl	H	N	5-F-ピリミジン-2-オキシ
1-60	6-F	Cl	H	N	O(CH ₂) ₃ CF ₃
1-61	6-CN	Cl	H	N	5-Cl-ピリミジン-2-オキシ
1-62	6-CN	F	H	N	5-Cl-ピリミジン-2-オキシ
1-63	6-CN	F	H	N	5-F-ピリミジン-2-オキシ
1-64	6-Me	Cl	H	N	5-Cl-ピリミジン-2-オキシ
1-65	6-Me	Cl	H	N	5-F-ピリミジン-2-オキシ
1-66	6-Me	Cl	H	N	5-Cl-3-F-ピリジン-2-オキシ
1-67	H	F	H	N	4-フルオロフェノキシ
1-68	H	Cl	CN	N	(CH ₂) ₃ CF ₃
1-69	H	Cl	CN	N	4-フルオロベンジル
1-70	H	F	H	N	5-Cl-ピリミジン-2-オキシ
1-71	3-CN	Cl	CN	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル
1-72	H	F	CN	N	(CH ₂) ₃ CF ₃
1-73	H	Cl	CN	CH	(CH ₂) ₃ CF ₃
1-74	H	Cl	H	CH	4-フルオロフェノキシ

10

20

30

40

50

実施例番号	R ²	R ³	R ⁵	A	Q
1-75	H	H	H	N	5-F-ピリミジン-2-オキシ
1-76	H	H	H	N	5-Cl-ピリミジン-2-オキシ
1-77	H	H	H	N	5-Cl-3-F-ピリジン-2-オキシ
1-78	H	Cl	CN	N	3,4-ジフルオロフェニル
1-79	H	F	CN	N	3,4-ジフルオロフェニル
1-80	H	Cl	CN	CH	3,4-ジフルオロフェニル
1-81	H	F	CN	N	4-フルオロベンジル
1-82	H	Cl	CN	CH	4-フルオロベンジル
1-83	H	Br	CN	N	4-フルオロフェノキシ
1-84	H	Cl	CN	CH	4-フルオロフェノキシ
1-85	H	Cl	CN	CCN	4-フルオロフェノキシ
1-86	H	Cl	CN	N	4-フルオロフェニルスルファニル
1-87	H	Br	H	N	4-フルオロフェノキシ
1-88	H	F	CN	N	4-フルオロフェニルスルファニル
1-89	H	F	H	N	5-F-ピリミジン-2-オキシ
1-90	H	F	H	N	5-Cl-3-F-ピリジン-2-オキシ
1-91	H	Cl	H	CH	5-Cl-ピリミジン-2-オキシ
1-92	H	F	H	CH	5-Cl-ピリミジン-2-オキシ
1-93	H	F	H	CH	5-F-ピリミジン-2-オキシ
1-94	H	Cl	H	CH	(CH ₂) ₃ CF ₃
1-95	H	F	H	N	4-フルオロベンジル
1-96	H	Cl	H	CH	4-フルオロベンジル
1-97	H	Cl	H	CH	3,4-ジフルオロフェニル
1-98	H	H	H	N	4-フルオロフェノキシ
1-99	H	Cl	H	N	4-フルオロフェニルスルファニル
1-100	H	Cl	H	CH	5-F-ピリミジン-2-オキシ

10

20

30

40

50

実施例番号	R ²	R ³	R ⁵	A	Q
1-101	H	Cl	H	CH	5-Cl-3-F-ピリジン-2-オキシ
1-102	H	Cl	CN	CH	4-フルオロフェニルスル
1-103	H	F	H	CH	5-Cl-3-F-ピリジン-2-オキシ
1-104	H	F	H	N	4-フルオロフェニルスル
1-105	H	Cl	H	CH	4-フルオロフェニルスル
1-106	H	Cl	H	CF	4-フルオロフェニルスル
1-107	H	Cl	CN	N	S(CH ₂) ₂ CF ₃
1-108	H	F	CN	N	S(CH ₂) ₂ CF ₃
1-109	H	Cl	CN	CH	S(CH ₂) ₂ CF ₃
1-110	H	Cl	H	CF	S(CH ₂) ₂ CF ₃
1-111	H	F	H	N	S(CH ₂) ₂ CF ₃
1-112	H	Cl	H	N	S(CH ₂) ₂ CF ₃
1-113	H	Cl	CN	CF	S(CH ₂) ₂ CF ₃
1-114	H	Cl	CN	N	S(CH ₂) ₃ CF ₃
1-115	H	F	CN	N	S(CH ₂) ₃ CF ₃
1-116	H	Cl	CN	CF	S(CH ₂) ₃ CF ₃
1-117	H	Cl	CN	CH	S(CH ₂) ₃ CF ₃
1-118	H	Cl	CN	N	CH ₂ CF ₂
1-119	H	Cl	H	N	CH ₂ CF ₂
1-120	H	F	CN	N	CH ₂ CF ₂
1-121	H	F	H	N	CH ₂ CF ₂
1-122	H	Cl	CN	CH	CH ₂ CF ₂
1-123	H	Cl	H	CH	CH ₂ CF ₂
1-124	H	F	CN	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イ
1-125	H	Cl	CN	CCN	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イ

10

20

30

40

50

実施例番号	R ²	R ³	R ⁵	A	Q
1-126	H	Cl	CN	CF	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル
1-127	H	Cl	H	CF	3,4-ジフルオロフェニル
1-128	3-CN	F	CN	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル
1-129	H	F	H	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル
1-130	H	Cl	H	CF	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル
1-131	3-CN	F	H	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル
1-132	H	Cl	CN	N	3-(CHF ₂)-イソオキサゾール-5-イル
1-133	H	Cl	H	N	3-(CHF ₂)-イソオキサゾール-5-イル
1-134	H	F	CN	N	3-(CHF ₂)-イソオキサゾール-5-イル
1-135	H	F	H	N	3-(CHF ₂)-イソオキサゾール-5-イル
1-136	H	Cl	CN	N	2,4-Cl ₂ -フェニルスルファニル
1-137	H	Cl	H	N	2,4-Cl ₂ -フェニルスルファニル
1-138	3-Br	Cl	CN	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル
1-139	H	Cl	CN	N	5-(CHF ₂)-イソオキサゾール-3-イル
1-140	3-Cl	Cl	H	N	3-(CHF ₂)-イソオキサゾール-5-イル
1-141	H	Cl	H	N	4-フルオロフェニルスルフィニル
1-142	H	Cl	H	N	4-フルオロフェニルスルホニル
1-143	H	F	H	N	4-フルオロフェニルスルフィニル
1-144	H	F	H	N	4-フルオロフェニルスルホニル
1-145	H	Cl	H	N	2,4-Cl ₂ -フェニルスルフィニル
1-146	H	F	CN	N	2,4-Cl ₂ -フェニルスルファニル
1-147	H	F	H	N	2,4-Cl ₂ -フェニルスルファニル
1-148	H	F	H	N	2,4-Cl ₂ -フェニルスルフィニル
1-149	H	F	H	N	SO(CH ₂) ₂ CF ₃

10

20

30

40

50

実施例番号	R ²	R ³	R ⁵	A	Q
1-150	H	F	H	N	SO ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃
1-151	3-F	Cl	H	N	5-Cl-ピリミジン-2-オキシ
1-152	3-F	Cl	H	N	5-F-ピリミジン-2-オキシ
1-153	3-F	F	H	N	5-F-ピリミジン-2-オキシ
1-154	3-F	F	H	N	5-Cl-ピリミジン-2-オキシ
1-155	3-Cl	Cl	H	N	5-F-ピリミジン-2-オキシ
1-156	3-Cl	F	H	N	5-F-ピリミジン-2-オキシ
1-157	3-Cl	F	H	N	5-Cl-ピリミジン-2-オキシ
1-158	H	Cl	H	N	1,2,4-オキサジアゾール-3-イル
1-159	H	Cl	H	N	5-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル
1-160	H	Cl	H	N	5-(CHF ₂)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル
1-161	H	Cl	H	N	5-(CF ₃)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル
1-162	3-Me	F	H	N	5-F-ピリミジン-2-オキシ
1-163	H	F	H	N	2,4-Cl ₂ -フェニルスルホニル
1-164	H	Cl	H	N	2,4-Cl ₂ -フェニルスルホニル
1-165	3-Me	Cl	H	N	5-F-ピリミジン-2-オキシ
1-166	3-Me	Cl	H	N	5-Cl-ピリミジン-2-オキシ
1-167	H	Cl	H	N	5-Cl-ピリミジン-2-イルスルファニル
1-168	H	Cl	H	N	S(CH ₂) ₃ CF ₃
1-169	H	Cl	H	N	5-Cl-ピリミジン-2-イルスルファニル
1-170	H	Cl	H	N	5-Cl-ピリミジン-2-イルスルホニル
1-171	H	Cl	H	N	5-F-ピリミジン-2-オキシ
1-172	H	F	CN	N	4-Cl-ピラゾール-1-イルメチル
1-173	H	F	H	N	4-Cl-ピラゾール-1-イルメチル
1-174	H	Cl	CN	N	4-Cl-ピラゾール-1-イルメチル

10

20

30

40

50

実施例番号	R ²	R ³	R ⁵	A	Q
1-175	H	Cl	H	N	4-Cl-ピラゾール-1-イルメチル
1-176	H	F	CN	N	4-Br-ピラゾール-1-イルメチル
1-177	H	F	H	N	4-Br-ピラゾール-1-イルメチル
1-178	H	Cl	CN	N	4-Br-ピラゾール-1-イルメチル
1-179	H	Cl	H	N	4-Br-ピラゾール-1-イルメチル
1-180	H	F	CN	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イルメチル
1-181	H	F	H	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イルメチル
1-182	H	Cl	CN	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イルメチル
1-183	H	Cl	H	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イルメチル
1-184	3-Me	Cl	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₃ Cl
1-185	3-F	F	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₃ Cl
1-186	3-F	Br	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₃ CF ₃
1-187	3-F	Br	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃
1-188	3-Me	Cl	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₃ CF ₃
1-189	3-Me	Cl	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃
1-190	3-Cl	Cl	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₃ Cl
1-191	3-Cl	F	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₃ Cl
1-192	3-F	Br	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₃ Cl
1-193	3-F	Cl	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₃ Cl
1-194	6-F	F	H	CH	5-Cl-ピリミジン-2-オキシ
1-195	3-F	Cl	H	N	O(CH ₂) ₃ CF ₃
1-196	H	Cl	H	N	SO(CH ₂) ₃ CF ₃
1-197	H	Cl	H	N	SO ₂ (CH ₂) ₃ CF ₃
1-198	H	Cl	H	N	S(CH ₂) ₃ Cl
1-199	H	Cl	H	N	SO(CH ₂) ₃ Cl

10

20

30

40

50

実施例番号	R ²	R ³	R ⁵	A	Q
1-200	H	Cl	H	N	SO ₂ (CH ₂) ₃ Cl
1-201	H	Cl	H	N	5-F-ピリミジン-2-イル-スルファニル
1-202	H	F	H	N	5-F-ピリミジン-2-イル-スルファニル
1-203	H	F	H	N	SO(CH ₂) ₃ CF ₃
1-204	H	F	H	N	SO ₂ (CH ₂) ₃ CF ₃
1-205	H	F	H	N	SO(CH ₂) ₃ Cl
1-206	H	F	H	N	SO ₂ (CH ₂) ₃ Cl
1-207	3-Br	F	CN	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル
1-208	3-Br	Cl	H	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル
1-209	3-Br	F	H	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル

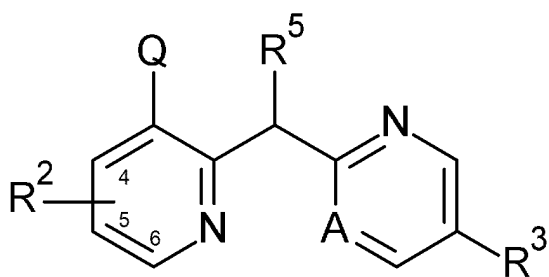
10

20

【 0 0 5 5 】

上記で引用され、適切な時点で列挙された調製実施例と同様に、以下に特定し、表 2 に示す一般式の化合物が得られる。

【 化 1 0 】



30

【 0 0 5 6 】

表 2

40

50

【表 2】

実施例番号	R ²	R ³	R ⁵	A	Q
2-1	4,6-Me ₂	F	H	N	3-(CHF ₂)-イソオキサゾール-5-イル
2-2	4,6-Me ₂	Cl	H	N	3-(CHF ₂)-イソオキサゾール-5-イル
2-3	6-Me	F	H	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル
2-4	6-Me	Cl	H	N	4-(CF ₃)-ピラゾール-1-イル
2-5	4,6-Me ₂	F	CN	N	3-(CHF ₂)-イソオキサゾール-5-イル
2-6	4,6-Me ₂	Cl	CN	N	3-(CHF ₂)-イソオキサゾール-5-イル
2-7	6-Me	F	H	N	5-Cl-ピリミジン-2-オキシ
2-8	6-Me	F	H	N	5-F-ピリミジン-2-オキシ
2-9	6-Me	F	H	N	O(CH ₂) ₃ CF ₃
2-10	6-Me	F	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₃ CF ₃
2-11	6-Me	Cl	H	N	OSO ₂ (CH ₂) ₃ CF ₃
2-12	6-Me	Cl	H	N	5-F-ピリミジン-2-オキシ
2-13	6-Me	Cl	H	N	5-Cl-ピリミジン-2-オキシ
2-14	6-Me	Cl	H	N	O(CH ₂) ₃ CF ₃

10

20

【0057】

30

開示された実施例のNMRデータは、従来の形式（ δ 値、水素原子の数、多重項分裂）またはいわゆるNMRピークリストのいずれかで列挙される。NMRピークリスト法において、選択された実施例のNMRデータは、NMRピークリストの形式で記録され、最初に各シグナルピークの δ 値がppmで列挙され、次にスペースで区切られてシグナル強度が列挙される。異なるシグナルピークの δ 値とシグナル強度の数値のペアは、セミコロンで区切られて列挙される。

【0058】

したがって、一実施例のピークリストは、次の形式を有する：

δ_1 （強度₁）； δ_2 （強度₂）；．．．． δ_i （強度_i）；．．．．．； δ_n （強度_n）

【0059】

40

鋭いシグナルの強度はNMRスペクトルの印刷例におけるシグナルの高さ（cm）と相関し、シグナル強度の真の比を示す。広いシグナルの場合、いくつかのピークまたはシグナルの中央およびその相対強度が、スペクトル中の最も強いシグナルと比較して示される。

【0060】

¹H NMRスペクトルの化学シフトの較正は、テトラメチルシランおよび／または溶媒の化学シフトを用いて、特にDMSO中で測定されるスペクトルのケースで達成される。したがって、テトラメチルシランピークはNMRピークリストにおいて生じ得るが、必ずしも生じない。

【0061】

50

^1H NMRピークの一覧は従来の ^1H NMRプリントアウトと類似しているため、通常、従来のNMR解釈に列挙される全てのピークを含む。

【0062】

さらに、従来の ^1H NMRプリントアウトと同様に、それらは、溶媒のシグナル、本発明により同様に提供される標的化合物の立体異性体のシグナル、および／または不純物ピークを示し得る。

【0063】

溶媒および／または水のデルタレンジ内の化合物シグナルの報告において、 ^1H NMRピークの本発明者らの一覧は標準的な溶媒ピーク、例えば、 d_6 -DMSO中のDMSOのピークおよび水のピークを示し、これは、通常、高強度を有する。

10

【0064】

そのような立体異性体および／または不純物は、特定の調製プロセスに典型的であり得る。したがって、それらのピークは、この場合、「副生成物の指紋 (by-product fingerprints)」を参照して、本発明者らの調製プロセスの再現を識別するのに役立ち得る。

【0065】

既知の方法 (Mestrec、ACDシミュレーション、しかしまた経験的に評価された期待値) によって標的化合物のピークを計算する専門家は必要であれば、所望によりさらなる強度フィルターを用いて標的化合物のピークを単離することができる。この単離は、従来の ^1H NMR解釈における関連するピークピッキングと類似する。

20

【0066】

^1H NMRピークリストのさらなる詳細は、Research Disclosure Database Number 564025に見出すことができる。

30

40

50

【表 3】

1-8: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.5935 (16.0); 7.2666 (2.8); 7.2593 (13.1); 7.2472 (3.2); 7.2422 (1.2); 7.2274 (1.2); 7.2231 (0.9); 6.9818 (1.2); 6.9791 (1.3); 6.9631 (1.9); 6.9606 (2.2); 6.9446 (1.0); 6.9419 (1.0); 6.8306 (1.9); 6.8107 (1.8); 4.2924 (10.2); 3.9605 (2.0); 3.9460 (3.8); 3.9315 (2.1); 2.1705 (1.0); 2.1561 (0.8); 2.1511 (1.0); 2.1433 (1.4); 2.1303 (1.4); 2.1240 (1.0); 2.1161 (0.9); 2.1033 (1.3); 1.9217 (0.8); 1.9075 (1.9); 1.9014 (0.8); 1.8935 (1.4); 1.8819 (1.4); 1.8672 (1.2); 1.8531 (0.5); 1.5572 (5.5); 0.0079 (0.5); -0.0002 (19.7); -0.0085 (0.6)
1-30: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.7038 (0.6); 8.5508 (16.0); 7.5383 (0.9); 7.5336 (1.0); 7.5197 (1.1); 7.5150 (1.1); 7.2971 (0.6); 7.2814 (1.6); 7.2781 (1.3); 7.2638 (2.6); 7.2599 (15.8); 7.2451 (2.6); 7.2262 (0.9); 6.9087 (2.3); 6.9028 (0.7); 6.8916 (0.9); 6.8886 (2.5); 6.8857 (3.0); 6.8830 (0.8); 6.8717 (0.7); 6.8657 (2.7); 6.6096 (2.8); 6.6036 (0.8); 6.5989 (2.8); 6.5928 (1.3); 6.5866 (2.3); 6.5819 (0.8); 6.5760 (2.3); 5.6286 (5.7); 2.0636 (12.7); 1.5742 (2.8); 0.0080 (0.6); -0.0002 (22.1); -0.0085 (0.6)
1-31: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.4912 (16.0); 7.2597 (13.4); 7.2084 (0.7); 7.2026 (0.8); 7.1905 (1.3); 7.1857 (2.5); 7.1747 (2.6); 7.1692 (1.0); 7.1612 (4.2); 7.1443 (1.7); 7.1252 (0.7); 6.8735 (2.9); 6.8675 (0.9); 6.8563 (1.1); 6.8531 (3.3); 6.8504 (3.6); 6.8473 (1.0); 6.8361 (1.0); 6.8301 (3.4); 6.5935 (3.5); 6.5875 (1.0); 6.5827 (3.6); 6.5766 (1.8); 6.5705 (2.8); 6.5656 (1.0); 6.5597 (2.8); 4.1887 (10.7); 2.0819 (15.9); 1.5606 (3.2); 0.0080 (0.6); -0.0002 (21.5); -0.0085 (0.6)
1-32: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.5384 (11.9); 7.2942 (2.4); 7.2855 (2.1); 7.2778 (6.4); 7.2658 (0.5); 7.2602 (5.9); 7.0347 (1.2); 7.0267 (1.1); 7.0185 (0.9); 7.0104 (1.0); 6.8871 (1.8); 6.8811 (0.6); 6.8700 (0.7); 6.8669 (2.0); 6.8640 (2.4); 6.8610 (0.7); 6.8499 (0.6); 6.8438 (2.2); 6.6412 (2.2); 6.6351 (0.7); 6.6304 (2.3); 6.6242 (1.1); 6.6181 (1.8); 6.6134 (0.6); 6.6074 (1.7); 5.6813 (5.0); 3.7180 (16.0); 1.5507 (1.9); -0.0002 (9.1)
1-33: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.5451 (0.5); 8.5400 (0.5); 8.5311 (1.1); 8.5256 (1.1); 8.4703 (9.9); 7.8904 (0.6); 7.8854 (0.7); 7.7775 (1.2); 7.7721 (1.2); 7.2599 (6.7); 7.2387 (0.6); 7.2255 (0.6); 7.2165 (1.8); 7.2032 (0.8); 7.1967 (2.0); 7.1767 (1.6); 7.0271 (0.9); 7.0057 (1.4); 6.9834 (0.7); 6.9717 (1.0); 6.9681 (1.3); 6.9523 (1.0); 6.9487 (1.0); 6.9417 (1.3); 6.9383 (1.0); 6.9212 (1.1); 6.9177 (0.9); 6.8561 (1.7); 6.8501 (0.6); 6.8389 (0.7); 6.8356 (2.0); 6.8330 (2.3); 6.8298 (0.6); 6.8187 (0.6); 6.8127 (2.1); 6.6308 (2.2); 6.6247 (0.7); 6.6199 (2.3); 6.6138 (1.1); 6.6077 (1.7); 6.6028 (0.6); 6.5969 (1.7); 5.8979 (1.4); 5.4981 (1.4); 4.2343 (6.6); 3.7303 (16.0); 1.2555 (0.5); -0.0002 (10.4)
1-34: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.5742 (16.0); 7.4893 (0.8); 7.4860 (1.4); 7.4826 (0.8); 7.4697 (1.0); 7.4664 (1.7); 7.4631 (1.0); 7.3097 (0.8); 7.2970 (0.8); 7.2890 (1.4); 7.2765 (1.4); 7.2694 (1.2); 7.2602 (8.8); 7.2567 (1.2); 7.2316 (1.2); 7.2275 (1.2); 7.2107 (0.8); 7.2064 (1.8); 7.2023 (1.2); 7.1855 (0.8); 7.1815 (0.7); 6.9401 (2.4); 6.9340 (0.8); 6.9229 (1.1); 6.9200 (2.7); 6.9170 (3.4); 6.9142 (0.9); 6.9031 (0.9); 6.8970 (3.1); 6.7468 (1.9); 6.7456 (2.0); 6.7409 (0.6); 6.7363 (1.9); 6.7349 (1.9); 6.7301 (1.0); 6.7285 (1.0); 6.7238 (1.6); 6.7194 (0.6); 6.7177 (0.6); 6.7132 (1.6); 5.7416 (5.8); 2.0451 (0.5); 1.5480 (4.3); 1.2645 (0.6); 1.2593 (0.7); 0.8818 (1.2); -0.0002 (13.2)
1-35: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.4948 (16.0); 7.2591 (3.2); 7.1849 (1.7); 7.1729 (1.5); 7.1656 (2.1); 7.1550 (3.6); 7.1505 (3.2); 7.1362 (0.7); 7.1179 (1.3); 7.1126 (1.0); 7.0986 (0.7); 7.0928 (1.7); 7.0859 (1.1); 7.0746 (0.7); 7.0680 (0.7); 6.9020 (2.8); 6.8959 (1.0); 6.8849 (1.2); 6.8818 (3.2); 6.8788 (4.0); 6.8758 (1.1); 6.8648 (1.1); 6.8586 (3.7); 6.7225 (2.4); 6.7177 (0.8); 6.7160 (0.8); 6.7129 (2.3); 6.7117 (2.3); 6.7068 (1.2); 6.7053 (1.1); 6.7006 (1.8); 6.6960 (0.7); 6.6944 (0.7); 6.6898 (1.9); 4.2929 (11.6); -0.0002 (5.0)
1-36: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.5542 (16.0); 7.7121 (1.4); 7.7083 (1.9); 7.6917 (2.0); 7.6896 (3.4); 7.6862 (1.9); 7.6698 (2.6); 7.6660 (1.8); 7.2660 (2.2); 7.2601 (8.7); 7.2462 (3.5); 7.2264 (1.8); 6.9304 (2.5); 6.9244 (0.8); 6.9132 (1.1); 6.9104 (2.9); 6.9073 (3.2); 6.9046 (0.9); 6.8934 (0.8); 6.8873 (2.9); 6.6307 (3.1); 6.6246 (0.9); 6.6201 (3.1); 6.6138 (1.5); 6.6076 (2.4); 6.6030 (0.9); 6.5971 (2.4); 5.6483 (5.7); 1.5471 (3.9); -0.0002 (13.1)
1-37: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.4932 (16.0); 7.5783 (2.2); 7.5747 (2.3); 7.5583 (2.5); 7.5547 (2.5); 7.3411 (2.0); 7.3388 (2.0); 7.3373 (2.0); 7.3220 (2.5); 7.3203 (2.4); 7.3183 (2.4); 7.2605 (8.0); 7.1500 (2.4); 7.1305 (3.8); 7.1109 (1.9); 6.8987 (3.0); 6.8928 (1.2); 6.8884 (0.7); 6.8784 (4.6); 6.8758 (4.6); 6.8658 (0.8); 6.8614 (1.3); 6.8555 (3.5); 6.6290 (3.8); 6.6229 (1.9); 6.6183 (3.9); 6.6122 (2.3); 6.6060 (3.2); 6.6013 (1.6); 6.5954 (3.0); 4.2303 (12.8); 1.5673 (10.3); 1.5618 (3.0); 0.0078 (0.6); -0.0002 (12.5)
1-38: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.5194 (16.0); 7.6424 (1.3); 7.6383 (2.1); 7.6292 (2.4); 7.6248 (2.2); 7.6191 (2.5); 7.6097 (2.9); 7.6055 (1.5); 7.3387 (2.5); 7.3193 (4.2); 7.3000 (1.9); 7.2606 (19.8); 6.9387 (3.0); 6.9327 (1.0); 6.9215 (1.3); 6.9186 (3.4); 6.9156 (4.1); 6.9128 (1.2); 6.9017 (1.1); 6.8957 (3.8); 6.7203 (3.9); 6.7143 (1.2); 6.7098 (4.0); 6.7035 (2.0); 6.6973 (3.1); 6.6927 (1.1); 6.6867 (3.0); 4.2657 (11.5); 1.5936 (0.9); 1.2555 (0.6); 0.0080 (0.8); -0.0002 (31.4); -0.0085 (0.9)
1-39: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.5849 (9.8); 8.0022 (0.7); 7.9984 (0.7); 7.9823 (0.8); 7.9787 (0.8); 7.7902 (0.8); 7.7733 (0.8); 7.7705 (0.8); 7.5115 (0.6); 7.4919 (1.0); 7.4721 (0.5); 7.2601 (30.9); 6.9373 (1.5); 6.9174 (1.6); 6.9142 (1.9); 6.8944 (1.8); 6.6568 (1.7); 6.6464 (1.7); 6.6401 (0.8); 6.6338 (1.4); 6.6234 (1.4); 5.5496 (3.6); 3.5556 (0.6); 1.5372 (16.0); 1.2646 (0.8); 0.8820 (1.6); 0.8643 (0.6); 0.0080 (1.2); -0.0002 (47.4); -0.0085 (1.4)

10

20

30

40

50

1-40: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.5846 (2.7); 8.5170 (16.0); 7.6642 (1.7); 7.6447 (1.9); 7.5634 (1.6); 7.5454 (2.0); 7.3682 (1.4); 7.3489 (2.3); 7.3296 (1.0); 7.2602 (9.7); 6.9172 (0.6); 6.9141 (0.6); 6.8945 (0.7); 6.8851 (2.9); 6.8792 (1.0); 6.8649 (3.8); 6.8622 (4.2); 6.8522 (0.5); 6.8479 (1.1); 6.8419 (3.4); 6.6572 (0.6); 6.6465 (0.7); 6.6355 (3.8); 6.6294 (1.6); 6.6248 (3.8); 6.6187 (1.9); 6.6127 (2.8); 6.6079 (1.2); 6.6021 (2.8); 5.5507 (1.1); 4.1416 (12.1); 1.5578 (5.1); -0.0002 (14.4); -0.0084 (0.6)	
1-51: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.6534 (0.6); 8.4811 (11.9); 8.4030 (16.0); 7.3662 (0.6); 7.3503 (0.6); 7.3455 (1.3); 7.3297 (1.3); 7.3248 (0.8); 7.3090 (0.8); 7.2604 (18.0); 7.0931 (0.8); 7.0904 (0.8); 7.0703 (1.3); 7.0497 (0.7); 7.0471 (0.7); 6.9855 (0.9); 6.9828 (1.6); 6.9650 (0.8); 6.9623 (1.4); 4.3211 (4.7); 4.3191 (4.8); 0.0080 (0.8); -0.0002 (26.2); -0.0085 (0.8)	
1-52: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.4874 (15.2); 8.3362 (16.0); 7.3623 (1.1); 7.3423 (2.8); 7.3217 (2.8); 7.3054 (1.3); 7.2602 (22.3); 7.0809 (2.0); 7.0607 (3.8); 7.0388 (1.8); 6.9812 (3.8); 6.9607 (3.4); 4.3277 (14.9); 2.0456 (0.6); 1.5511 (7.9); 1.2578 (0.6); -0.0002 (32.1)	10
1-53: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.6539 (1.6); 8.4959 (9.4); 8.4161 (12.0); 7.5732 (1.3); 7.5703 (1.2); 7.5532 (1.5); 7.5503 (1.4); 7.2692 (1.2); 7.2603 (26.8); 7.2490 (2.6); 7.2288 (1.5); 7.1483 (1.6); 7.1455 (1.5); 7.1279 (1.1); 7.1251 (1.0); 4.5010 (6.9); 1.5457 (16.0); 0.0079 (0.9); -0.0002 (29.6); -0.0085 (1.1)	
1-54: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.5010 (14.4); 8.3471 (16.0); 7.5655 (2.2); 7.5629 (2.1); 7.5456 (2.5); 7.5429 (2.4); 7.2670 (2.1); 7.2603 (25.0); 7.2471 (4.1); 7.2269 (2.3); 7.1496 (2.7); 7.1472 (2.6); 7.1293 (1.9); 4.5088 (12.2); 1.5484 (12.3); 0.0078 (1.1); -0.0002 (27.2); -0.0083 (1.4)	
1-55: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.6053 (1.4); 8.5087 (13.2); 7.7817 (3.6); 7.7762 (3.8); 7.5513 (1.8); 7.5485 (1.8); 7.5313 (2.2); 7.5285 (2.0); 7.4680 (2.3); 7.4626 (2.0); 7.4456 (2.1); 7.4401 (2.0); 7.2600 (32.2); 7.2446 (1.9); 7.2243 (3.5); 7.2171 (0.6); 7.2072 (1.1); 7.2041 (2.0); 7.1113 (2.2); 7.1085 (2.1); 7.0909 (1.7); 7.0882 (1.5); 6.0097 (0.5); 4.5072 (10.1); 1.5440 (16.0); 1.3053 (0.6); 1.2881 (0.6); 0.0079 (1.2); -0.0002 (35.1); -0.0085 (1.4)	
1-56: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.6665 (0.8); 8.6526 (2.5); 8.4919 (13.3); 8.4166 (16.0); 7.3932 (1.2); 7.3901 (1.4); 7.3730 (2.4); 7.3699 (2.4); 7.3329 (2.2); 7.3127 (3.4); 7.2926 (1.5); 7.2607 (10.4); 7.1088 (1.9); 7.1057 (2.0); 7.0887 (1.7); 7.0855 (1.7); 4.5396 (0.6); 4.4688 (10.2); 1.5691 (3.7); -0.0002 (11.4)	20
1-57: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.4974 (14.3); 8.3480 (16.0); 7.3860 (1.3); 7.3829 (1.5); 7.3658 (2.8); 7.3627 (2.8); 7.3309 (2.4); 7.3108 (3.7); 7.2906 (1.6); 7.2610 (8.9); 7.1102 (2.2); 7.1071 (2.3); 7.0901 (1.9); 7.0871 (1.9); 4.4769 (12.0); 1.5731 (3.1); -0.0002 (9.8); -0.0083 (0.6)	
1-58: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.6051 (2.7); 8.5054 (14.6); 8.2917 (0.7); 8.2864 (0.7); 7.7789 (4.1); 7.7734 (4.4); 7.4725 (2.5); 7.4670 (2.4); 7.4500 (2.4); 7.4445 (2.4); 7.3723 (1.4); 7.3692 (1.5); 7.3522 (2.7); 7.3490 (2.5); 7.3085 (2.3); 7.2883 (3.8); 7.2820 (0.6); 7.2681 (1.8); 7.2602 (26.2); 7.1743 (0.8); 7.1719 (0.6); 7.1534 (0.5); 7.0712 (2.1); 7.0680 (2.1); 7.0510 (1.8); 7.0479 (1.8); 6.0263 (0.8); 5.2995 (1.8); 4.4743 (10.8); 1.5494 (16.0); 0.0079 (0.8); -0.0002 (28.6); -0.0085 (1.1)	
1-59: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.5012 (2.7); 8.4897 (13.4); 8.3474 (3.2); 8.3217 (16.0); 7.6656 (1.7); 7.6624 (1.8); 7.6466 (2.2); 7.6434 (2.1); 7.4907 (1.5); 7.4703 (2.8); 7.4510 (2.1); 7.4048 (2.4); 7.4015 (2.3); 7.3842 (1.5); 7.3810 (1.3); 7.2610 (22.6); 7.2474 (0.9); 7.1502 (0.5); 7.1474 (0.5); 5.3000 (5.4); 4.5370 (10.3); 4.5091 (2.2); 1.5564 (7.2); 0.0079 (0.8); -0.0002 (24.7); -0.0068 (0.9); -0.0084 (1.2)	30
1-60: ¹ H-NMR (400.6 MHz, CDCl ₃): δ= 8.5813 (16.0); 7.2598 (17.3); 7.2388 (0.8); 7.2220 (0.9); 7.2179 (1.8); 7.2012 (1.8); 7.1971 (1.1); 7.1804 (1.0); 6.7924 (1.0); 6.7902 (1.1); 6.7692 (1.9); 6.7491 (1.0); 6.7468 (1.0); 6.6467 (1.9); 6.6259 (1.8); 4.3464 (6.4); 4.3441 (6.6); 3.9739 (1.9); 3.9593 (3.6); 3.9447 (2.0); 2.1342 (0.9); 2.1191 (0.8); 2.1149 (0.9); 2.1072 (1.3); 2.0941 (1.3); 2.0882 (0.9); 2.0800 (0.9); 2.0672 (1.2); 1.9222 (0.8); 1.9080 (1.9); 1.9019 (0.7); 1.8941 (1.4); 1.8886 (1.0); 1.8831 (1.3); 1.8678 (1.1); 0.0080 (0.7); -0.0002 (26.1); -0.0085 (0.7)	

【 0 0 6 7 】

最終生成物の NMR データ（従来型）：

【 0 0 6 8 】

以下のセクションに記載される化学実施例について与えられた ¹H NMR 分光データ（¹H NMR については 400 MHz、溶媒 CDCl₃ または d₆-DMSO、内標準物質：テトラメチルシラン δ = 0.00 ppm）は、Bruker の装置で得られ、列挙されたシグナルは以下に与えられる意味を有する：b = ブロード；s = シングレット、d = ダブルット、t = トリプレット、dd = ダブルットのダブルット、ddd = ダブルットのダブルットのダブルット、m = マルチプレット、q = カルテット、quint = クインテット、sext = セクステット、sept = セプテット、dq = カルテットのダブルット、dt = トリプレットのダブルット。ジアステレオマー混合物の場合、報告されているのは、2つのジアステレオマーのそれぞれについての有意なシグナルまたは主ジアステレオマーの特徴的なシグナルのいずれかである。

10

20

30

40

50

【表 4】

1-1: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.60 (s,2H); 7.29 (dd,1H); 7.22-7.15 (m,3H); 4.30 (s,2H); 2.78 (m,2H); 2.10 (m,2H); 1.79 (m,2H)
1-3: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.51 (s,2H); 7.29 (dd,1H); 7.22-7.15 (m,3H); 4.32 (s,2H); 2.78 (m,2H); 2.10 (m,2H); 1.79 (m,2H)
1-10: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.60 (s,2H); 7.42-7.27 (m,4H); 4.37 (s,2H); 3.46 (t,2H); 2.40-2.26 (m,4H)
1-14: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.62 (s,2H); 7.27-7.21 (m,1H); 7.14-7.12 (m,2H); 4.46 (s,2H); 3.56-3.48 (m,2H); 2.41-2.17 (m,4H)
1-15: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.53 (s,2H); 7.25-7.21 (m,1H); 7.14-7.09 (m,2H); 4.48 (s,2H); 3.56-3.52 (m,2H); 2.41-2.27 (m,4H)
1-16: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.62 (s,2H); 7.28-7.23 (m,1H); 7.16-7.11 (m,2H); 4.45 (s,2H); 3.71-3.67 (m,2H); 2.93-2.84 (m,2H)
1-17: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.53 (s,2H); 7.26-7.23 (m,1H); 7.16-7.11 (m,2H); 4.47 (s,2H); 3.71-3.67 (m, 2H); 2.90-2.84 (m,2H)
1-18: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.62 (s,2H); 7.39-7.37 (m,1H); 7.24-7.18 (m,2H); 4.51 (s,2H); 3.67-3.63 (t,2H); 2.45-2.30 (m,4H)
1-19: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.53 (s,2H); 7.39-7.37 (m,1H); 7.24-7.18 (m,2H); 4.52 (s,2H); 3.67-3.63 (t,2H); 2.43-2.29 (m,4H)
1-20: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.62 (s,2H); 7.40-7.38 (m,1H); 7.27-7.20 (m,2H); 4.49 (s,2H); 3.82-3.78 (m,2H); 2.96-2.84 (m,2H)
1-21: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.53 (s,2H); 7.40-7.38 (m,1H); 7.27-7.20 (m,2H); 4.50 (s,2H); 3.82-3.78 (m,2H); 2.96-2.84 (m,2H)
1-23: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.53 (s,2H); 7.31-7.22 (m,3H); 7.11 (m,1H); 6.99 (m,2H); 6.90 (m,2H); 4.25 (s,2H); 4.05 (s,2H)
1-26: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.57 (s,2H); 7.34-7.18 (m,5H); 7.13 (m,1H); 7.07 (m,1H); 4.25 (s,2H)
1-27: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.48 (s,2H); 7.34-7.18 (m,5H); 7.13 (m,1H); 7.06 (m,1H); 4.27 (s,2H)
1-29: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.55 (s,2H); 7.33 (dd,1H); 7.23 (ddd,1H); 7.11 (dd,1H); 6.94 (m,2H); 6.85-6.79 (m,3H); 4.35 (s,2H)
1-41: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.61 (s,2H); 7.91 (s,2H); 7.82 (dd,1H); 7.59-7.51 (m,2H); 7.38 (dd,1H); 6.04 (s,1H)
1-42: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.54 (s,2H); 8.00 (m,1H); 7.84 (s,1H); 7.46-7.36 (m,4H); 4.29 (s,2H)
1-45: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.54 (s,2H); 7.98 (m,1H); 7.95 (s,1H); 7.75 (dd,1H); 7.73 (dd,1H); 7.59 (dd,1H); 4.20 (s,2H)
1-50: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.48 (s,2H); 8.40 (s,2H); 7.43 (dd,1H); 7.35 (ddd,1H); 7.28 (dd,1H); 7.13 (d,1H); 4.26 (s,2H)
1-64: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.45 (s,2H); 8.39 (s,2H); 7.26 (dd,1H); 7.16 (d,1H); 6.99 (dd,1H); 4.32 (s,2H); 2.40 (s,3H)
1-65: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.46 (s,2H); 8.32 (s,2H); 7.29-7.24 (m,1H); 7.14 (dd,1H); 6.99 (d,1H); 4.33 (s,2H); 2.39 (s,3H)
1-66: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.47 (s,2H); 7.72 (d,1H); 7.44 (dd,1H); 7.24 (dd,1H); 7.14 (d,1H); 6.95 (d,1H); 4.30 (s,2H); 2.41 (s,3H)
1-67: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.47 (s,2H); 7.33 (dd,1H); 7.22 (ddd,1H); 7.11 (ddd,1H); 6.94 (m,2H); 6.85-6.79 (m,3H); 4.37 (s,2H)
1-68: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.68 (s,2H); 7.60 (dd,1H); 7.34-7.28 (m,2H); 7.22 (dd,1H); 5.61 (s,1H); 2.87 (m,2H); 2.17 (m,2H); 1.87 (m,2H)
1-69: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.60 (s,2H); 7.65 (m,1H); 7.37-7.31 (m,2H); 7.15 (m,1H); 7.01-6.92 (m,4H); 5.56 (s,1H); 4.25 (d,1H); 4.07 (d,1H)
1-70: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.41 (s,2H); 8.40 (s,2H); 7.43 (dd,1H); 7.35 (ddd,1H); 7.28 (ddd,1H); 7.13 (dd,1H); 4.28 (s,2H)
1-71: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.60 (s,2H); 8.14 (dd,1H); 8.00 (s,1H); 7.94 (s,1H); 7.87 (dd,1H); 7.74 (dd,1H); 5.73 (s,1H)
1-72: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.59 (s,2H); 7.61 (dd,1H); 7.36-7.28 (m,2H); 7.22 (dd,1H); 5.64 (s,1H); 2.86 (m,2H); 2.17 (m,2H); 1.86 (m,2H)
1-73: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.54 (dd,1H); 7.67 (dd,1H); 7.48 (dd,1H); 7.40-7.21 (m,4H); 5.47 (s,1H); 2.73 (m,2H); 2.11 (m,2H); 1.78 (m,2H)
1-74: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.46 (s,1H); 7.50 (d,1H); 7.31 (d,1H); 7.20 (dd,1H); 7.08 (m,2H); 6.97 (m,2H); 6.68-6.83 (m,3H); 4.16 (s,2H)
1-75: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.55 (d,2H); 8.31 (d,2H); 7.44 (dd,1H); 7.34 (ddd,1H); 7.27 (ddd,1H); 7.13 (dd,1H); 7.04 (t,1H); 4.29 (s,2H)
1-76: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.53 (d,2H); 8.38 (s,2H); 7.45 (dd,1H); 7.34 (ddd,1H); 7.28 (ddd,1H); 7.13 (dd,1H); 7.05 (t,1H); 4.28 (s,2H)
1-77: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.55 (d,2H); 7.73 (d,1H); 7.46-7.43 (m,2H); 7.32 (ddd,1H); 7.26 (ddd,1H); 7.10 (dd,1H); 7.05 (t,1H); 4.27 (s,2H)
1-78: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.68 (s,2H); 7.62 (m,1H); 7.44-7.38 (m,2H); 7.31-7.22 (m,3H); 7.16 (m,1H); 5.53 (s,1H)

10

20

30

40

50

1-79: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.58 (s,2H); 7.63 (m,1H); 7.44-7.38 (m,2H); 7.32-7.22 (m,3H); 7.15 (m,1H); 5.56 (s,1H)	
1-80: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.50 (dd,1H); 7.64 (dd,1H); 7.52 (dd,1H); 7.46-7.38 (m,2H); 7.28-7.14 (m,4H); 7.06 (m,1H); 5.36 (s,1H)	
1-81: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.52 (s,2H); 7.66 (m,1H); 7.37-7.29 (m,2H); 7.15 (m,1H); 7.03-6.93 (m,4H); 5.59 (s,1H); 4.25 (d,1H); 4.07 (d,1H)	
1-82: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.51 (dd,1H); 7.58-7.52 (m,2H); 7.36-7.30 (m,2H); 7.18 (m,1H); 7.05-6.92 (m,5H); 5.41 (s,1H); 4.06 (d,1H); 4.00 (d,1H)	
1-83: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.75 (s,2H); 7.58 (d,1H); 7.32 (dd,1H); 7.16 (dd,1H); 7.03 (m,2H); 6.98 (m,2H); 6.80 (m,1H); 5.86 (s,1H)	
1-84: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.54 (s,1H); 7.63 (d,1H); 7.57 (d,1H); 7.35 (d,1H); 7.28 (dd,1H); 7.15 (dd,1H); 7.02 (m,2H); 6.88 (m,2H); 6.76 (d,1H); 5.68 (s,1H)	
1-85: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.75 (d,1H); 7.90 (d,1H); 7.68 (dd,1H); 7.30 (m,1H); 7.16 (ddd,1H); 7.02 (m,2H); 6.88 (m,2H); 6.75 (dd,1H); 6.13 (s,1H)	10
1-86: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.63 (s,2H); 7.71 (m,1H); 7.42-7.38 (m,2H); 7.33 (m,1H); 7.18 (m,2H); 6.97 (m,2H); 6.22 (s,1H)	
1-87: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.64 (s,2H); 7.33 (dd,1H); 7.23 (ddd,1H); 7.13 (ddd,1H); 6.94 (m,2H); 6.85-6.79 (m,3H); 4.33 (s,2H)	
1-88: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.55 (s,2H); 7.71 (m,1H); 7.41-7.30 (m,3H); 7.19 (m,2H); 6.97 (m,2H); 6.24 (s,1H)	
1-89: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.41 (s,2H); 8.34 (s,2H); 7.42 (dd,1H); 7.35 (ddd,1H); 7.27 (ddd,1H); 7.13 (dd,1H); 4.29 (s,2H)	
1-90: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.41 (s,2H); 7.75 (d,1H); 7.46 (dd,1H); 7.43 (dd,1H); 7.33 (ddd,1H); 7.26 (ddd,1H); 7.10 (dd,1H); 4.27 (s,2H)	
1-91: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.41 (s,2H); 8.38 (m,1H); 7.45 (dd,1H); 7.37-7.32 (m,2H); 7.26 (ddd,1H); 7.12 (dd,1H); 7.03 (d,1H); 4.08 (s,2H)	
1-92: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.41 (s,2H); 8.29 (d,1H); 7.37-7.31 (m,2H); 7.28-7.19 (m,3H); 7.12 (dd,1H); 7.07 (dd,1H); 4.09 (s,2H)	
1-93: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.34 (s,2H); 8.28 (d,1H); 7.37-7.31 (m,2H); 7.27-7.19 (m,3H); 7.12 (dd,1H); 7.07 (dd,1H); 4.10 (s,2H)	20
1-94: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.49 (d,1H); 7.53 (dd,1H); 7.23-7.17 (m,4H); 6.93 (d,1H); 4.16 (s,2H); 2.66 (m,2H); 2.05 (m,2H); 1.72 (m,2H)	
1-95: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.45 (s,2H); 7.29-7.21 (m,3H); 7.11 (m,1H); 7.00 (m,2H); 6.90 (m,2H); 4.27 (s,2H); 4.06 (s,2H)	
1-96: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.46 (dd,1H); 7.44 (dd,1H); 7.25-7.12 (m,4H); 6.98 (m,2H); 6.90 (m,2H); 6.78 (dd,1H); 4.10 (s,2H); 3.93 (s,2H)	
1-97: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.44 (dd,1H); 7.48 (dd,1H); 7.36-7.21 (m,4H); 7.17-7.05 (m,2H); 6.95 (m,1H); 6.80 (dd,1H); 4.08 (s,2H)	
1-98: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.62 (d,2H); 7.35 (ddd,1H); 7.22 (ddd,1H); 7.11 (ddd,1H); 7.06 (t,1H); 6.92 (m,2H); 6.85-6.79 (m,3H); 4.38 (s,2H)	
1-99: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.56 (s,2H); 7.35-7.20 (m,4H); 7.15 (m,2H); 6.93 (m,2H); 4.50 (s,2H)	
1-100: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.39 (m,1H); 8.34 (s,2H); 7.46 (dd,1H); 7.37-7.32 (m,2H); 7.25 (ddd,1H); 7.12 (dd,1H); 7.05 (d,1H); 4.10 (s,2H)	
1-101: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.39 (m,1H); 7.78 (d,1H); 7.48 (dd,1H); 7.47 (d,1H); 7.36-7.30 (m,2H); 7.23 (ddd,1H); 7.10 (dd,1H); 7.03 (d,1H); 4.10 (s,2H)	
1-102: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.53 (dd,1H); 7.67 (dd,1H); 7.60 (dd,1H); 7.41-7.29 (m,3H); 7.22-7.14 (m,3H); 6.99 (m,2H); 6.00 (s,1H)	
1-103: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.30 (d,1H); 7.78 (d,1H); 7.46 (dd,1H); 7.37-7.32 (m,2H); 7.25-7.20 (m,2H); 7.09 (dd,1H); 7.05 (dd,1H); 4.10 (s,2H)	30
1-104: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.48 (s,2H); 7.34-7.21 (m,4H); 7.18 (m,2H); 6.94 (m,2H); 4.52 (s,2H)	
1-105: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.48 (d,1H); 7.50 (dd,1H); 7.30-7.15 (m,6H); 7.00-6.94 (m,3H); 4.32 (s,2H)	
1-106: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.28 (d,1H); 7.35 (dd,1H); 7.30-7.18 (m,4H); 7.16 (m,2H); 6.94 (m,2H); 4.32 (s,2H)	
1-107: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.69 (s,2H); 7.64 (m,1H); 7.56 (m,1H); 7.40-7.36 (m,2H); 6.30 (s,1H); 3.15 (m,1H); 3.05 (m,1H); 2.38 (m,2H)	
1-108: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.60 (s,2H); 7.65 (m,1H); 7.56 (m,1H); 7.40-7.36 (m,2H); 6.32 (s,1H); 3.14 (m,1H); 3.04 (m,1H); 2.38 (m,2H)	
1-109: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.54 (s,1H); 7.68 (dd,1H); 7.57 (m,1H); 7.51 (m,1H); 7.40-7.34 (m,3H); 6.05 (s,1H); 3.09 (m,1H); 3.02 (m,1H); 2.36 (m,2H)	
1-110: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.31 (d,1H); 7.43-7.41 (m,2H); 7.27-7.17 (m,3H); 4.36 (s,2H); 3.02 (m,2H); 2.33 (m,2H)	
1-111: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.52 (s,2H); 7.44 (m,1H); 7.33-7.24 (m,3H); 4.54 (s,2H); 3.02 (m,2H); 2.33 (m,2H)	
1-112: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	40

δ= 8.61 (s,2H); 7.44 (m,1H); 7.33-7.25 (m,3H); 4.52 (s,2H); 3.03 (m,2H); 2.33 (m,2H)	
1-113: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.43 (dd,1H); 7.65 (m,1H); 7.53-7.34 (m,4H); 6.26 (d,1H); 3.04 (m,2H); 2.34 (m,2H)	
1-114: ¹ H-NMR (600.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.69 (s,2H); 7.66 (dd,1H); 7.52 (dd,1H); 7.37-7.32 (m,2H); 6.30 (s,1H); 2.98 (m,2H); 2.24 (m,2H); 1.87 (m,2H)	
1-115: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.60 (s,2H); 7.62 (m,1H); 7.52 (m,1H); 7.37-7.32 (m,2H); 6.32 (d,1H); 2.98 (m,2H); 2.24 (m,2H); 1.87 (m,2H)	
1-116: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.43 (dd,1H); 7.63 (m,1H); 7.51-7.32 (m,4H); 6.28 (d,1H); 2.95 (m,2H); 2.19 (m,2H); 1.86 (m,2H)	
1-117: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.55 (d,1H); 7.67 (dd,1H); 7.56 (m,1H); 7.48 (m,1H); 7.38-7.29 (m,3H); 6.05 (s,1H); 2.94 (m,2H); 2.19 (m,2H); 1.85 (m,2H)	
1-118: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.70 (s,2H); 7.61 (m,1H); 7.33-7.30 (m,2H); 7.23 (m,1H); 5.60 (s,1H); 3.07 (m,2H); 2.49 (m,1H); 2.38 (m,1H)	
1-119: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.61 (s,2H); 7.28 (m,1H); 7.23-7.17 (m,3H); 4.31 (s,2H); 2.99 (m,2H); 2.36 (m,2H)	10
1-120: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.61 (s,2H); 7.62 (m,1H); 7.35-7.29 (m,2H); 7.23 (m,1H); 5.63 (s,1H); 3.07 (m,2H); 2.49 (m,1H); 2.38 (m,1H)	
1-121: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.52 (s,2H); 7.29 (m,1H); 7.25-7.17 (m,3H); 4.33 (s,2H); 2.99 (m,2H); 2.35 (m,2H)	
1-122: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.54 (dd,1H); 7.70 (dd,1H); 7.48 (dd,1H); 7.37-7.30 (m,3H); 7.24 (dd,1H); 5.47 (s,1H); 2.95 (m,2H); 2.34 (m,2H)	
1-123: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.50 (d,1H); 7.54 (dd,1H); 7.25-7.17 (m,4H); 6.97 (d,1H); 4.17 (s,2H); 2.87 (m,2H); 2.26 (m,2H)	
1-124: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.52 (s,2H); 7.91 (s,1H); 7.90 (m,1H); 7.83 (dd,1H); 7.57 (ddd,1H); 7.53 (ddd,1H); 7.38 (dd,1H); 6.06 (s,1H)	
1-125: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.65 (d,1H); 7.94 (s,1H); 7.90-7.88 (m,2H); 7.79 (m,1H); 7.62-7.54 (m,2H); 7.36 (dd,1H); 6.26 (s,1H)	
1-126: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.40 (dd,1H); 7.94-7.90 (m,2H); 7.69 (m,1H); 7.63-7.50 (m,2H); 7.39 (m,1H); 7.32 (dd,1H); 6.13 (s,1H)	
1-127: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.30 (dd,1H); 7.34-7.27 (m,3H); 7.22-7.12 (m,4H); 7.02 (m,1H); 4.10 (d,2H)	
1-128: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.52 (s,2H); 8.15 (dd,1H); 8.00 (s,1H); 7.93 (m,1H); 7.88 (dd,1H); 7.75 (dd,1H); 5.76 (s,1H)	20
1-129: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.45 (s,2H); 7.99 (m,1H); 7.84 (s,1H); 7.46-7.36 (m,4H); 4.31 (d,2H)	
1-130: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.24 (dd,1H); 7.87 (m,1H); 7.86 (s,1H); 7.46-7.32 (m,5H); 4.15 (d,2H)	
1-131: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.46 (s,2H); 7.97 (m,1H); 7.95 (s,1H); 7.75 (dd,1H); 7.73 (dd,1H); 7.59 (dd,1H); 4.22 (s,2H)	
1-132: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.68 (s,2H); 7.84 (dd,1H); 7.67 (dd,1H); 7.59 (dt,1H); 7.52 (ddd,1H); 6.95 (s,1H); 6.83 (t,1H); 5.95 (s,1H)	
1-133: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.60 (s,2H); 7.70 (dd,1H); 7.48-7.39 (m,3H); 6.87 (s,1H); 6.79 (t,1H); 4.50 (s,2H)	
1-134: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.59 (s,2H); 7.84 (dd,1H); 7.67 (dd,1H); 7.59 (dt,1H); 7.52 (ddd,1H); 6.94 (s,1H); 6.83 (t,1H); 5.97 (s,1H)	
1-135: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.51 (s,2H); 7.70 (d,1H); 7.48-7.38 (m,3H); 6.87 (s,1H); 6.79 (t,1H); 4.52 (s,2H)	
1-136: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.57 (s,2H); 7.82 (dd,1H); 7.55-7.51 (m,2H); 7.43 (m,1H); 7.37 (m,1H); 6.99 (m,1H); 6.55 (d,1H); 6.21 (s,1H)	
1-137: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.49 (s,2H); 7.49 (d,1H); 7.44-7.42 (m,2H); 7.35-7.31 (m,2H); 6.94 (dd,1H); 6.53 (d,1H); 4.48 (s,2H)	30
1-138: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.60 (s,2H); 7.95 (s,1H); 7.82 (d,1H); 7.78 (dd,1H); 7.70 (s,1H); 7.49 (dd,1H); 5.42 (s,1H)	
1-139: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 10.50 (bs,1H); 8.75 (s,2H); 7.90 (d,1H); 7.81 (dd,1H); 7.68 (m,1H); 7.62 (m,1H); 6.25 (m,1H); 5.91 (t,1H)	
1-140: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.55 (s,2H); 7.45 (dd,1H); 7.42 (dd,1H); 7.34 (dd,3H); 6.81 (t,1H); 6.57 (s,1H); 4.22 (s,2H)	
1-141: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.55 (s,2H); 7.92 (d,1H); 7.62-7.59 (m,2H); 7.51-7.44 (m,2H); 7.31 (d,1H); 7.11-7.07 (m,2H); 4.53 (d,1H); 4.46 (d,1H)	
1-142: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.46 (s,2H); 8.26 (dd,1H); 7.83-7.80 (m,2H); 7.59 (m,1H); 7.51 (m,1H); 7.27 (d,1H); 7.09-7.05 (m,2H); 4.66 (s,2H)	
1-143: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.47 (s,2H); 7.92 (dd,1H); 7.63-7.59 (m,2H); 7.51-7.43 (m,2H); 7.31 (m,1H); 7.11-7.06 (m,2H); 4.53 (d,1H); 4.48 (d,1H)	
1-144: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.38 (s,2H); 8.26 (dd,1H); 7.85-7.81 (m,2H); 7.58 (m,1H); 7.50 (m,1H); 7.28 (d,1H); 7.10-7.05 (m,2H); 4.67 (s,2H)	
1-145: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	
δ= 8.60 (s,2H); 7.92 (d,1H); 7.56 (dd,1H); 7.44-7.33 (m,5H); 4.88 (d,1H); 4.50 (d,1H)	
1-146: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃):	40

10

20

30

40

50

δ= 8.50 (s,2H); 7.81 (dd,1H); 7.54-7.50 (m,2H); 7.42 (m,1H); 7.38 (m,1H); 7.00 (dd,1H); 6.60 (d,1H); 6.24 (s,1H) 1-147: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.42 (d,2H); 7.48 (dd,1H); 7.43-7.40 (m,2H); 7.34-7.30 (m,2H); 6.95 (dd,1H); 6.57 (d,1H); 4.50 (s,2H) 1-148: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.51 (s,2H); 7.94 (d,1H); 7.55-7.47 (m,2H); 7.49 (m,5H); 4.91 (d,1H); 4.53 (d,1H) 1-149: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.50 (s,2H); 7.97 (dd,1H); 7.33-7.24 (m,2H); 7.41 (d,1H); 4.47 (d,1H); 4.38 (d,1H); 3.36 (m,1H); 3.13 (m,1H); 2.71 (m,1H); 2.40 (m,1H) 1-150: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.49 (s,2H); 8.06 (d,1H); 7.60 (dd,1H); 7.53 (d,1H); 7.47 (dd,1H); 4.89 (s,2H); 3.79 (m,2H); 2.55 (m,2H) 1-151: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.48 (s,2H); 8.42 (s,2H); 7.24-7.20 (m,2H); 7.11 (m,1H); 4.32 (s,2H) 1-152: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.48 (s,2H); 8.35 (s,2H); 7.24-7.19 (m,2H); 7.11 (m,1H); 4.34 (s,2H) 1-153: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.40 (s,2H); 8.35 (s,2H); 7.24-7.20 (m,2H); 7.11 (m,1H); 4.32 (s,2H) 1-154: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.43 (d,2H); 8.39 (s,2H); 7.24-7.19 (m,2H); 7.11 (m,1H); 4.33 (s,2H) 1-155: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.49 (s,2H); 8.33 (s,2H); 7.40 (dd,1H); 7.35 (dd,1H); 7.23 (dd,1H); 4.28 (s,2H) 1-156: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.41 (s,2H); 8.34 (s,2H); 7.40 (dd,1H); 7.35 (dd,1H); 7.22 (dd,1H); 4.29 (s,2H) 1-157: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.41 (s,2H); 8.40 (s,2H); 7.40 (dd,1H); 7.35 (dd,1H); 7.23 (dd,1H); 4.29 (s,2H) 1-158: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.70 (s,1H); 8.56 (s,2H); 8.09 (dd,1H); 7.50 (m,1H); 7.45 (m,1H); 7.38 (m,1H); 4.80 (s,2H) 1-159: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.57 (s,2H); 8.03 (dd,1H); 7.47 (m,1H); 7.41 (m,1H); 7.34 (m,1H); 4.78 (s,2H); 2.61 (s,3H) 1-160: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.55 (s,2H); 8.09 (dd,1H); 7.52 (m,1H); 7.45 (m,1H); 7.39 (m,1H); 6.83 (t,1H); 4.78 (s,2H) 1-161: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.58 (s,2H); 8.11 (dd,1H); 7.54 (m,1H); 7.47 (m,1H); 7.40 (m,1H); 4.78 (s,2H) 1-162: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.39 (s,2H); 8.32 (s,2H); 7.26 (d,1H); 7.20-7.19 (m,2H); 4.22 (s,2H); 2.10 (s,3H) 1-163: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.35 (dd,1H); 8.33 (s,2H); 8.21 (d,1H); 7.61 (ddd,1H); 7.52 (ddd,1H); 7.33-7.27 (m,3H); 4.56 (s,2H) 1-164: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.41 (s,2H); 8.36 (dd,1H); 8.19 (d,1H); 7.62 (ddd,1H); 7.52 (ddd,1H); 7.32-7.28 (m,3H); 4.55 (s,2H) 1-165: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.48 (s,2H); 8.32 (s,2H); 7.27 (m,1H); 7.20-7.19 (m,2H); 4.21 (s,2H); 2.10 (s,3H) 1-166: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.47 (s,2H); 8.39 (s,2H); 7.27 (m,1H); 7.21-7.20 (m,2H); 4.20 (s,2H); 2.10 (s,3H) 1-167: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.53 (s,2H); 8.36 (s,2H); 7.66 (dd,1H); 7.47-7.45 (m,2H); 7.36 (ddd,1H); 4.50 (s,2H) 1-168: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.61 (s,2H); 7.41 (ddd,1H); 7.34-7.19 (m,3H); 4.50 (s,2H); 2.93 (t,2H); 2.20 (m,2H); 1.84 (m,2H) 1-169: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.69 (s,2H); 8.61 (s,2H); 8.02 (dd,1H); 7.43-7.40 (m,2H); 7.30 (dd,1H); 5.02 (d,1H); 4.53 (d,1H) 1-170: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.76 (s,2H); 8.42 (s,2H); 8.37 (dd,1H); 7.62 (ddd,1H); 7.53 (m,1H); 7.38 (dd,1H); 4.77 (s,2H) 1-171: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.49 (s,2H); 8.34 (s,2H); 7.43 (dd,1H); 7.35 (ddd,1H); 7.27 (ddd,1H); 7.13 (dd,1H); 4.27 (s,2H) 1-180: ¹H-NMR (300.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.93 (d,2H); 8.44 (s,1H); 7.90 (s,1H); 7.52-7.33 (m,3H); 7.13 (m,1H); 6.53 (s,1H); 5.70 (d, H); 5.59 (d,1H) 1-182: ¹H-NMR (300.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.95 (s,2H); 8.44 (s,1H); 7.88 (s,1H); 7.52-7.33 (m,3H); 7.14 (m,1H); 6.52 (s,1H); 5.69 (d, H); 5.58 (d,1H) 1-184: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.61 (s,2H); 7.19-7.16 (m,3H); 4.43 (s,2H); 3.76-3.74 (t,2H); 3.70-3.66 (t,2H); 2.52-2.40 (m,2H); 2.31 (s,3H) 1-185: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.53 (s,2H); 7.25-7.20 (m,1H); 7.14-7.09 (m,2H); 4.48 (s,2H); 3.75-3.72 (t,2H); 3.67-3.63 (t,2H); 2.53-2.46 (m,2H) 1-186: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.71 (s,2H); 7.25-7.21 (m,1H); 7.14-7.09 (m,2H); 4.44 (s,2H); 3.56-3.52 (m,2H); 2.41-2.27 (m,4H) 1-187: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.71 (s,2H); 7.32-7.24 (m,1H); 7.22-7.17 (m,2H); 4.42 (s,2H); 3.71-3.61 (m,2H); 2.89-2.57 (m,2H) 1-188: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.60 (s,2H); 7.20-7.16 (m,3H); 4.42 (s,2H); 3.56 (t,2H); 2.43-2.26 (m,7H) 1-189: ¹H-NMR (400.0 MHz, CDCl₃): δ= 8.61 (s,2H); 7.24-7.21 (m,1H); 7.19-7.08 (m,2H); 4.39 (s,2H); 3.80-3.71 (m,2H); 2.93-2.83 (m,2H); 2.39 (S,3H)	
---	--

10

20

30

40

50

1-190: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.62 (s,2H); 7.39-7.37 (m,1H); 7.25-7.20 (m,2H); 4.51 (s,2H); 3.77-3.73 (m,4H); 2.55-2.49 (m,2H)	
1-191: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.53 (s,2H); 7.39-7.36 (m,1H); 7.25-7.17 (m,2H); 4.53 (s,2H); 3.77-3.73 (m,4H); 2.56-2.49 (m,2H)	
1-192: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.71 (s,2H); 7.24-7.20 (m,1H); 7.14-7.09 (m,2H); 4.44 (s,2H); 3.75-3.72 (t,2H); 3.67-3.63 (t,2H); 2.53-2.46 (m,2H)	
1-193: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.62 (s,2H); 7.25-7.20 (m,1H); 7.14-7.09 (m,2H); 4.47 (s,2H); 3.75-3.72 (t,2H); 3.67-3.63 (t,2H); 2.53-2.46 (m,2H)	
1-194: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.38 (s,2H); 8.19 (s,1H); 7.35-7.29 (m,1H); 7.21-7.17 (m,1H); 7.10-7.04 (m,2H); 6.96-6.95 (m,1H); 4.15 (s,2H)	
1-195: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.61 (s,2H); 7.05-6.95 (m,3H); 4.31 (s,2H); 4.08 (t,2H); 2.29 (m,2H); 1.92 (m,2H)	
1-196: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.60 (s,2H); 7.98 (dd,1H); 7.51 (ddd,1H); 7.45 (ddd,1H); 7.38 (dd,1H); 4.46 (d,1H); 4.35 (d,1H); 3.12 (m,1H); 2.91 (m,1H); 2.31-1.97 (m,4H)	10
1-197: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.60 (s,2H); 8.07 (ddd,1H); 7.58 (ddd,1H); 7.48-7.44 (m,2H); 4.85 (s,2H); 3.51 (t,2H); 2.27 (m,2H); 2.03 (m,2H)	
1-198: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.62 (s,2H); 7.42 (dd,1H); 7.28-7.18 (m,3H); 4.50 (s,2H); 3.61 (t,2H); 3.03 (t,2H); 2.03 (quint,2H)	
1-199: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.61 (s,2H); 7.99 (dd,1H); 7.51 (ddd,1H); 7.45 (ddd,1H); 7.37 (dd,1H); 4.49 (d,1H); 4.37 (d,1H); 3.72 (m,1H); 3.62 (m,1H); 3.27 (m,1H); 2.93 (m,1H); 2.36 (m,1H); 2.22 (m,1H)	
1-200: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.61 (s,2H); 8.07 (ddd,1H); 7.58 (ddd,1H); 7.48-7.44 (m,2H); 4.86 (s,2H); 3.65-3.57 (m,4H); 2.23 (m,2H)	
1-201: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.53 (s,2H); 8.32 (d,2H); 7.67 (dd,1H); 7.48-7.43 (m,2H); 7.35 (ddd,1H); 4.51 (s,2H)	
1-202: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.46 (s,2H); 8.32 (d,2H); 7.67 (dd,1H); 7.48-7.41 (m,2H); 7.35 (ddd,1H); 4.52 (s,2H)	
1-203: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.50 (s,2H); 7.98 (dd,1H); 7.51 (ddd,1H); 7.45 (ddd,1H); 7.38 (dd,1H); 4.48 (d,1H); 4.38 (d,1H); 3.12 (m,1H); 2.89 (m,1H); 2.31-1.97 (m,4H)	
1-204: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.51 (s,2H); 8.07 (ddd,1H); 7.58 (ddd,1H); 7.48-7.44 (m,2H); 4.86 (s,2H); 3.51 (t,2H); 2.27 (m,2H); 2.03 (m,2H)	20
1-205: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.52 (s,2H); 7.99 (dd,1H); 7.51 (ddd,1H); 7.45 (ddd,1H); 7.37 (dd,1H); 4.50 (dd,1H); 4.39 (d,1H); 3.72 (m,1H); 3.62 (m,1H); 3.27 (m,1H); 2.93 (m,1H); 2.36 (m,1H); 2.22 (m,1H)	
1-206: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.52 (s,2H); 8.07 (dd,1H); 7.58 (ddd,1H); 7.48-7.43 (m,2H); 4.88 (s,2H); 3.65-3.57 (m,4H); 2.23 (m,2H)	
1-207: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.51 (s,2H); 7.95 (s,1H); 7.83 (dd,1H); 7.78 (dd,1H); 7.68 (s,1H); 7.49 (dd,1H); 5.45 (s,1H)	
1-208: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.53 (s,2H); 7.89 (s,1H); 7.67 (m,1H); 7.65 (dd,1H); 7.41 (dd,1H); 7.35 (dd,1H); 4.12 (s,2H)	
1-209: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.44 (s,2H); 7.89 (s,1H); 7.65 (s,1H); 7.64 (dd,1H); 7.41 (dd,1H); 7.35 (dd,1H); 4.13 (s,2H)	
2-1: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.46 (s,2H); 7.06 (s,1H); 6.77 (t,1H); 6.46 (s,1H); 4.44 (s,2H); 2.56 (s,3H); 2.20 (s,3H)	
2-2: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.56 (s,2H); 7.06 (s,1H); 6.78 (t,1H); 6.49 (s,1H); 4.42 (s,2H); 2.55 (s,3H); 2.20 (s,3H)	
2-5: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.56 (s,2H); 7.15 (s,1H); 6.82 (t,1H); 6.71 (s,1H); 6.60 (s,1H); 2.56 (s,3H); 2.22 (s,3H)	
2-6: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.65 (s,2H); 7.17 (s,1H); 6.84 (t,1H); 6.73 (s,1H); 6.59 (s,1H); 2.56 (s,3H); 2.23 (s,3H)	30
2-7: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.42 (s,2H); 8.41 (s,2H); 7.38 (d,1H); 7.16 (d,1H); 4.50 (s,2H); 2.58 (s,3H)	
2-8: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.41 (s,2H); 8.35 (s,2H); 7.38 (d,1H); 7.15 (d,1H); 4.50 (s,2H); 2.57 (s,3H)	
2-9: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.50 (s,2H); 7.02 (s,2H); 4.53 (d,2H); 3.91 (t,2H); 2.49 (s,3H); 2.05 (m,2H); 1.87 (m,2H)	
2-10: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.51 (s,2H); 7.58 (d,1H); 7.12 (d,1H); 4.58 (d,2H); 3.43 (t,2H); 2.55 (s,3H); 2.37-2.22 (m,4H)	
2-11: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.60 (s,2H); 7.58 (d,1H); 7.12 (d,1H); 4.56 (d,2H); 3.43 (t,2H); 2.55 (s,3H); 2.37-2.22 (m,4H)	
2-12: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.49 (s,2H); 8.34 (s,2H); 7.39 (d,1H); 7.16 (d,1H); 4.49 (s,2H); 2.57 (s,3H)	
2-13: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.48 (s,2H); 8.45 (s,2H); 7.94 (d,1H); 7.52 (d,1H); 4.76 (s,2H); 2.85 (s,3H)	
2-14: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.56 (s,2H); 7.61 (d,1H); 7.46 (d,1H); 4.81 (s,2H); 4.08 (t,2H); 2.78 (s,3H); 2.04 (m,2H); 1.96 (m,2H)	40

【 0 0 6 9 】

本発明はさらに、上記で定義されたような一般式（Ⅰ）の１つ以上の化合物および／またはその塩、好ましくは好ましいまたは特に好ましいと同定された実施形態の１つにおける、特に式（１－１）～（１－２０９）、（２－１）～（２－１４）の１つ以上の化合物および／またはその塩の、それぞれ上記で定義されたとおりの除草剤および／または植物成長調節剤としての、好ましくは有用な植物の作物および／または観賞植物中における使用を提供する。

【 0 0 7 0 】

本発明はさらに、有害植物を防除するための、および／または植物の成長を調節するた

10

20

30

40

50

めの方法であって、有効量の

－ 上記で定義されたとおりの、一般式（Ⅰ）の1つ以上の化合物および／またはその塩、好ましくは、好ましいまたは特に好ましいと特定される実施形態の1つにおけるもの、特に、それぞれの場合に、上記に定義されたとおりの、式（1-1）～（1-209）または（2-1）～（2-14）の1つ以上の化合物および／またはその塩、または

－ 以下に定義される、本発明の組成物

が、（有害である）植物、（有害である）植物の種子、（有害である）植物がその中でまたはその上で生育する土壌または栽培下の領域に施用されることを特徴とする方法を提供する。

【0071】

本発明はまた、望ましくない植物を防除するための、好ましくは有用植物の作物中での望ましくない植物を防除するための方法であって、有効量の

－ 上記で定義されたとおりの、一般式（Ⅰ）の1つ以上の化合物および／またはその塩、好ましくは、好ましいまたは特に好ましいと特定される実施形態の1つにおけるもの、特に、それぞれの場合に、上記に定義されたとおりの、式（1-1）～（1-209）または（2-1）～（2-14）の1つ以上の化合物および／またはその塩、または

－ 以下に定義される、本発明の組成物

が、望ましくない植物（例えば、単子葉または双子葉の雑草または望ましくない作物植物などの有害植物）、望ましくない植物の種子（すなわち、植物種子、例えば、穀物、種子、または塊茎もしくは芽を有するシュート部分などの栄養繁殖器官）、望ましくない植物がその中でまたはその上で生育する土壌（例えば、作物の生育地または作物の非生育地の土壌）、または栽培下の領域（すなわち、望ましくない植物がその上で生育する領域）に施用されることを特徴とする方法を提供する。

【0072】

本発明はまた、有害植物を防除する方法、または植物の成長を調節する、好ましくは有用植物の成長を調節する方法であって、有効量の

－ 上記で定義されたとおりの、一般式（Ⅰ）の1つ以上の化合物および／またはその塩、好ましくは、好ましいまたは特に好ましいと特定される実施形態の1つにおけるもの、特に、それぞれの場合に、上記に定義したとおりの、式（1-1）～（1-209）または（2-1）～（2-14）の1つ以上の化合物および／またはその塩、または

－ 以下に定義される、本発明の組成物

が、植物、植物の種子（すなわち、植物の種子、例えば、穀物、種子、または塊茎もしくは芽を有するシュート部分などの栄養繁殖器官）、植物がその中でまたはその上で生育する土壌（例えば、農耕地または非農耕地の土壌）または栽培下の領域（すなわち、植物がその上で生育する領域）に施用されることを特徴とする方法を提供する。

【0073】

これに関連して、本発明の化合物または本発明の組成物は、例えば、播種前（適切であれば、土壌への取り込みによっても）、出芽前および／または出芽後方法によって施用することができる。本発明の化合物によって防除することができる単子葉および双子葉雑草相のいくつかの代表例の特定の例は以下の通りであるが、特定の種に限定して列挙する意図はない。

【0074】

有害植物を防除するための、または植物の成長を調節するための本発明による方法において、一般式（Ⅰ）の1つ以上の化合物および／またはその塩を、有用植物の作物もしくは観賞用植物中で有害植物を防除するために、または成長を調節するために使用することが好ましく、ここで、好ましい構成における有用植物または観賞用植物は、トランスジェニック植物である。

【0075】

一般式（Ⅰ）の本発明の化合物および／またはその塩は、単子葉および双子葉有害植物の以下の属を防除するのに適している：

10

20

30

40

50

【0076】

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

10

【0077】

双子葉有害植物の属：イチビ属 (*Abutilon*)、ヒユ属 (*Amaranthus*)、ブタクサ属 (*Ambrosia*)、アノダ属 (*Anoda*)、カミツレモドキ属 (*Anthemis*)、イワムシロ属 (*Aphanes*)、ヨモギ属 (*Artemisia*)、アトリプレックス属 (*Atriplex*)、ヒナギク属 (*Bellis*)、センダングサ属 (*Bidens*)、ナズナ属 (*Capsella*)、ヒレアザミ属 (*Carduus*)、ナンバンサイカチ属 (*Cassia*)、ヤグルマギク属 (*Centaurea*)、アカザ属 (*Chenopodium*)、アザミ属 (*Cirsium*)、セイヨウヒルガオ属 (*Convolvulus*)、チョウセンアサガオ属 (*Datura*)、ヌスビトハギ属 (*Desmodium*)、エメックス (*Emex*)、エゾスズシロ属 (*Erysimum*)、トウダイグサ属 (*Euphorbia*)、チシマオドリコソウ属 (*Galeopsis*)、コゴメギク属 (*Galinsoga*)、ヤエムグラ属 (*Galium*)、フヨウ属 (*Hibiscus*)、サツマイモ属 (*Ipomoea*)、ホウキギ属 (*Kochia*)、オドリコソウ属 (*Lamium*)、マメグンバイナズナ属 (*Lepidium*)、アゼナ属 (*Lindernia*)、シカレギク属 (*Matricaria*)、ハッカ属 (*Mentha*)、ヤマアイ属 (*Mercurialis*)、ザクロソウ属 (*Mullugo*)、ワスレナグサ属 (*Myosotis*)、ケシ属 (*Papaver*)、アサガオ属 (*Pharbitis*)、オオバコ属 (*Plantago*)、タデ属 (*Polygonum*)、スベリヒユ属 (*Portulaca*)、キンポウゲ属 (*Ranunculus*)、ダイコン属 (*Raphanus*)、イヌガラシ属 (*Rorippa*)、キカシグサ属 (*Rotala*)、スイバ属 (*Rumex*)、オカヒジキ属 (*Salsola*)、キオン属 (*Senecio*)、ツノクサネム属 (*Sesbania*)、キンゴジカ属 (*Sida*)、シロガラシ属 (*Sinapis*)、ナス属 (*Solanum*)、ハチジョウナ属 (*Sonchus*)、ナガボノウルシ属 (*Sphenoclea*)、ハコベ属 (*Stellaria*)、タンポポ属 (*Taraxacum*)、グンバイナズナ属 (*Thlaspi*)、ジャジクソウ属 (*Trifolium*)、イラクサ属 (*Urtica*)、クワガタソウ属 (*Veronica*)、スミレ属 (*Viola*)、オナモミ属 (*Xanthium*)。

20

30

40

【0078】

一般式 (I) の本発明の化合物を、有害植物 (イネ科雑草および／または広葉雑草) の発芽前に土壌表面に施用する場合 (出芽前方法)、イネ科雑草または広葉雑草の実生の出現は完全に防止されるか、またはそれらは子葉段階に達するまで成長するが、その後成長を停止し、最終的には3～4週間経過後に完全に枯死する。

50

【0079】

一般式（I）の活性成分が出芽後に植物の緑色部分に施用される場合、処理後に成長が停止し、有害植物は施用時の成長段階に留まるか、またはそれらは、ある時間後に完全に枯死し、その結果、このようにして、作物植物に有害な雑草による競争は非常に早期に、かつ持続的に排除される。

【0080】

一般式（I）の本発明の化合物は、単子葉雑草および双子葉雑草に対して優れた除草活性を有するが、経済的に重要な作物の作物植物、例えば、ラッカセイ属（*Arachis*）、フダンソウ属（*Beta*）、アブラナ属（*Brassica*）、キュウリ属（*Cucumis*）、カボチャ属（*Cucurbita*）、ヒマワリ属（*Helianthus*）、ニンジン属（*Daucus*）、ダイズ属（*Glycine*）、ワタ属（*Gossypium*）、サツマイモ属（*Ipomoea*）、アキノノゲシ属（*Lactuca*）、アマ属（*Linum*）、トマト属（*Lycopersicon*）、ススキ属（*Miscanthus*）、タバコ属（*Nicotiana*）、インゲンマメ属（*Phaseolus*）、エンドウ属（*Pisum*）、ナス属（*Solanum*）、ソラマメ属（*Vicia*）の双子葉作物、またはネギ属（*Allium*）、アナナス属（*Ananas*）、アスパラガス属（*Asparagus*）、カラスムギ属（*Avena*）、オオムギ属（*Hordeum*）、イネ属（*Oryza*）、キビ属（*Panicum*）、サトウキビ属（*Saccharum*）、ライムギ属（*Secale*）、モロコシ属（*Sorghum*）、ライコムギ属（*Triticale*）、コムギ属（*Triticum*）およびトウモロコシ属（*Zea*）の単子葉作物は、本発明によるそれぞれの活性化合物の構造およびその施用量に応じて、ほんのわずかしき損傷を受けないか、または全く損傷を受けない。これらの理由のために、本発明の化合物は、農業上で有用な植物または観賞用植物のような植物作物中での望ましくない植物成長の選択的防除に非常に適している。

【0081】

さらに、一般式（I）の本発明の化合物は（それらの特定の構造および展開される施用量に依存して）、作物植物において顕著な成長調節特性を有する。それらは、植物自身の代謝に調節効果を伴って介入し、したがって、植物構成成分の制御された影響のために、および例えば乾燥および発育阻止を誘発することによって収穫を容易にするために使用することができる。さらに、それらはまた、その方法において植物を枯死させることなく、望ましくない栄養成長の一般的な抑制および阻害に適している。栄養成長の阻害は、倒伏を減少させるか、または完全に防止することができるので、多くの単子葉および双子葉植物作物にとって主要な役割を果たす。

【0082】

それらの除草および植物成長調節特性のために、一般式（I）の化合物はまた、遺伝子組み換え植物または従来突然変異誘発によって改変された植物作物の中の有害植物を防除するために使用され得る。一般に、トランスジェニック植物は特に有利な特性、例えば、特定の農薬（*pesticides*）、特に特定の除草剤に対する耐性、植物病気または植物病気の病原体、例えば特定の昆虫または微生物、例えば真菌、細菌またはウイルスに対する耐性を特徴とする。他の特定の特性は例えば、量、品質、貯蔵性、組成および特定の成分に関する収穫された材料に関する。例えば、高いデンプン含量または変化したデンプン品質を有するトランスジェニック植物、または収穫された材料中に異なる脂肪酸組成を有するトランスジェニック植物が知られている。

【0083】

一般式（I）の本発明の化合物および／またはその塩を、例えばコムギ、オオムギ、ライムギ、オートムギ、キビ、イネおよびトウモロコシなどの穀類、またはその他のサトウダイコン、ワタ、ダイズ、アブラナ、ジャガイモ、トマト、エンドウマメおよび他の野菜のような有用な植物および鑑賞用の経済的に重要なトランスジェニック作物に使用することが、トランスジェニック作物の観点から好ましい。

【0084】

一般式（Ⅰ）の本発明の化合物を、除草剤の植物毒性作用に対して耐性であるか、または組換え手段によって耐性にされた有用な植物の作物中において除草剤として使用することも好ましい。

【0085】

一般式（Ⅰ）の本発明の化合物は、それらの除草および植物成長調節特性のおかげで、知られているかまたはまだ開発されていない遺伝子改変植物の作物中で有害植物を防除するためにも使用することができる。一般に、トランスジェニック植物は、特定の有利な特性、例えば、特定の農薬、特に特定の除草剤に対する耐性、植物病気または植物病気の病原体、例えば、特定の昆虫または微生物、例えば、真菌、細菌またはウイルスに対する耐性を特徴とする。他の特定の特性は例えば、量、品質、貯蔵性、組成および特定の成分に関する収穫された材料に関する。例えば、高いデンプン含量または変化したデンプン品質を有するトランスジェニック植物、または収穫された材料中に異なる脂肪酸組成を有するトランスジェニック植物が知られている。さらなる特定の特性は、非生物学的ストレス因子、例えば、熱、寒さ、干ばつ、塩分および紫外線に対する耐性または抵抗性であり得る。

10

【0086】

一般式（Ⅰ）の本発明の化合物またはその塩の、例えばコムギ、オオムギ、ライムギ、オート麦、ライコムギ、キビ、イネ、キャッサバおよびトウモロコシのような穀類、あるいはテンサイ、ワタ、ダイズ、アブラナ、ジャガイモ、トマト、エンドウマメの作物および他の野菜のような有用植物および鑑賞用植物の経済的に重要なトランスジェニック作物中における使用が好ましい。

20

【0087】

一般式（Ⅰ）の化合物を、除草剤の植物毒性効果に対して耐性であるか、または組換え手段によって耐性にされた有用植物の作物中で除草剤として使用することが好ましい。

【0088】

既存の植物と比較して改変された特性を有する新規植物を生産する従来の方法は、例えば、従来 of 栽培方法および突然変異体の生成にある。あるいは、改変された特性を有する新規植物は、組換え方法の助けを借りて作製することができる。

【0089】

改変された特性を有する新規なトランスジェニック植物を作製することができる手段による多数の分子生物学的技術が、当業者に知られている。このような遺伝子操作のために、DNA配列の組換えによる突然変異誘発または配列改変を可能にする核酸分子をプラスミドに導入することができる。標準的な方法を用いて、例えば、塩基交換を行うこと、部分配列を除去すること、または天然もしくは合成配列を付加することが可能である。DNA断片を互いに連結するために、アダプターまたはリンカーを断片に付加することができる。

30

【0090】

例えば、遺伝子産物の減少した活動を有する植物細胞の生成は、コサプレッション効果を達成するための少なくとも1つの対応するセンスRNA、アンチセンスRNAを発現することによって、または上記の遺伝子産物の転写物を特異的に切断する少なくとも1つの適切に構築されたリボザイムを発現することによって達成され得る。

40

【0091】

この目的のために、最初に、存在し得る任意の隣接配列を含む遺伝子産物の全コード配列を包含するDNA分子、およびコード配列の部分のみを包含するDNA分子を使用することが可能であり、この場合、これらの部分は、細胞においてアンチセンス効果を有するために十分に長いことが必要である。また、遺伝子産物のコード配列と高度の相同性を有するが、完全には同一ではないDNA配列を用いることも可能である。

【0092】

植物内で核酸分子を発現する場合、合成されるタンパク質は、植物細胞の任意の所望の区画に局在化され得る。しかしながら、特定の区画における局在化を達成するために、例えば、特定の区画における局在化を確実にするDNA配列にコード領域を結合することが

50

可能である。この種の配列は当業者に公知である（例えば、Braun等、EMBO J. 11 (1992), 3219-3227を参照）。核酸分子はまた、植物細胞の小器官において発現され得る。

【0093】

トランスジェニック植物細胞は、公知の技術によって再生されて、植物全体を生じることができる。原則として、トランスジェニック植物は、任意の所望の植物種の植物、すなわち単子葉植物だけでなく双子葉植物でもよい。

【0094】

このような方法で得ることができるのは、相同（＝天然）遺伝子または遺伝子配列の過剰発現、抑制または阻害、または異種（＝外来）遺伝子または遺伝子配列の発現によって変化した特性を有するトランスジェニック植物である。

10

【0095】

一般式（I）の本発明の化合物を、成長調節剤、例えば、ジカンバ、または必須植物酵素、例えば、アセト乳酸シンターゼ（ALS）、EPSPシンターゼ、グルタミンシンターゼ（GS）もしくはヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ（HPPD）を阻害する除草剤、またはスルホニル尿素、グリホサート、グルホシネートもしくはベンゾイルイソオキサゾールおよび類似の活性成分の群からの除草剤に耐性であるトランスジェニック作物中において使用することが好ましい。

【0096】

一般式（I）の本発明の化合物がトランスジェニック作物に使用される場合、他の作物において観察される有害植物に対する効果が生じるだけでなく、特定のトランスジェニック作物における施用に特異的な効果、例えば、防除され得る改変されたまたは特異的に広げられた雑草のスペクトル、施用に使用され得る改変された施用量、好ましくはトランスジェニック作物が耐性である除草剤との良好な組み合わせ可能性、およびトランスジェニック作物植物の成長および収量に影響を及ぼす効果も頻繁に生じる。

20

【0097】

したがって、本発明はまた、一般式（I）の本発明の化合物および／またはその塩の、有用植物の作物または観賞用植物中で、場合によりトランスジェニック作物植物中で、有害植物を防除するための除草剤としての使用に関する。

【0098】

穀類、ここでは好ましくはトウモロコシ、コムギ、オオムギ、ライムギ、オートムギ、キビまたはイネ、における出芽前または出芽後方法による一般式（I）の化合物の使用が好ましい。

30

【0099】

出芽前または出芽後方法によるダイズにおける一般式（I）の化合物の使用も好ましい。

【0100】

有害植物の防除または植物の成長調節のための式（I）の本発明の化合物の使用はまた、一般式（I）の化合物またはその塩が、植物上、植物中または土壌中への施用後まで前駆体物質（「プロドラッグ」）から形成されない場合を含む。

40

【0101】

本発明はまた、有害植物を防除するための、または植物の成長を調節するための（方法において）本発明による一般式（I）の1つ以上の化合物またはその塩、または組成物（以下に定義される）の使用であって、一般式（I）の1つ以上の化合物またはその塩の有効量を植物（有害植物、適切であれば、有用植物と一緒に）、植物種子、植物がその中またはその上で成長する土壌、または栽培下の領域に施用することを含む使用を提供する。

【0102】

本発明はまた、除草性および／または植物成長調節組成物であって、該組成物が、

（a） 上記で定義されたとおりの、一般式（I）の1つ以上の化合物および／またはその塩、好ましくは、好ましいまたは特に好ましいと特定された実施形態の1つにおける

50

もの、特に、それぞれの場合において、上記で定義されたとおりの、式(1-1)～(1-209)または(2-1)～(2-14)の1つ以上の化合物および／またはその塩、および

(b) 群(i)および／または(ii)から選択される1つ以上のさらなる物質：

(i) 1つ以上のさらなる農薬活性物質、好ましくは、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、さらなる除草剤（すなわち、上記で定義された一般式(I)に従わないもの）、殺菌剤、薬害軽減剤、肥料および／またはさらなる成長調節剤からなる群から選択されるもの、

(ii) 作物保護において慣習的な1つ以上の製剤補助剤を含むことを特徴とする、組成物を提供する。

10

【0103】

本発明の組成物の成分(i)のさらなる農薬活性物質は、好ましくは「The Pesticide Manual」、第16版、The British Crop Protection CouncilおよびRoyal Soc. of Chemistry、2012に記載される物質の群から選択される。

【0104】

本発明の除草剤または植物成長調節組成物は、好ましくは界面活性剤、乳化剤、分散剤、フィルム形成剤、増粘剤、無機塩、ダスティング剤、25℃および1013mbarで固体の担体、好ましくは吸着性粒状不活性物質、湿潤剤、酸化防止剤、安定剤、緩衝物質、消泡剤、水、有機溶媒、好ましくは25℃および1013mbarで任意の比率で水と混和性の有機溶媒からなる群から選択される作物保護において慣習的な1つ、2つ、3つまたはそれ以上の製剤補助剤(ii)を含む。

20

【0105】

一般式(I)の本発明の化合物は、通常の製剤中の水和剤（粉末）、乳剤、噴霧可能な溶液、粉剤または粒剤の形態で施用することができる。したがって、本発明はまた、本発明の一般式(I)の化合物および／またはその塩を含む除草性組成物および植物成長調節組成物を提供する。

【0106】

一般式(I)の本発明の化合物および／またはその塩は、生物学および／または物理化学的パラメーターが指定されるさまざまな方法で製剤化することができる。可能な製剤には、例えば、水和剤（粉末）(WP)、水溶性粉剤(SP)、水溶性濃縮物(water-soluble concentrates)、乳剤(EC)、エマルション(EW)、例えば、水性エマルションおよび油性エマルション、噴霧可能な溶液、サスペンション剤(SC)、油系もしくは水系の分散液、油脂混合溶液、カプセルサスペンション(CS)、粉剤(DP)、粉衣剤、散布および土壌施用のための粒剤、微粒剤の形態の粒剤(GR)、噴霧粒剤、吸収粒剤および吸着粒剤、顆粒水和剤(WG)、水溶性粒剤(SG)、ULV製剤、マイクロカプセルならびにワックスなどがある。

30

【0107】

個々の製剤タイプおよび製剤助剤、例えば、不活性材料、界面活性剤、溶媒およびさらなる添加剤、も当業者に知られており、例えば、Watkins, 「Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers」, 第2版, Darland Books, Caldwell N. J., H. v. Olphen, 「Introduction to Clay Colloid Chemistry」; 第2版, J. Wiley & Sons, N. Y., C. Marsden, 「Solvents Guide」; 第2版, Interscience, N. Y. 1963, McCutcheon's 「Detergents and Emulsifiers Annual」, MC Publ. Corp., Ridgewood N. J., Sisley and Wood, 「Encyclopedia of Surface Active Agents」, Chem. Publ. Co. Inc., N. Y. 1964, Schoenfeldt, 「Grenzfläachenaktive Aet

40

50

h y l e n o x i d a d d u k t e」 [I n t e r f a c e - a c t i v e E t h y l e n e o x i d e a d d u c t s] , W i s s . V e r l a g s g e s e l l s c h a f t . , S t u t t g a r t 1 9 7 6 , W i n n a c k e r - K u e c h l e r , 「 C h e m i s c h e T e c h n o l o g i e」 , 第 7 巻 , C . H a n s e r V e r l a g M u n i c h , 第 4 版 1 9 8 6 に記載されている。

【0108】

水和剤（粉末）（W e t t a b l e p o w d e r s）は、水中で均質に分散させることが可能な調製物であり、そして、活性成分に加えて、希釈剤または不活性物質とは別に、さらに、イオン性および／または非イオン性のタイプの界面活性剤（湿潤剤、分散剤）、例えば、ポリオキシエチル化アルキルフェノール、ポリオキシエチル化脂肪族アルコール、ポリオキシエチル化脂肪族アミン、脂肪族アルコールポリグリコールエーテルスルフェート、アルカンスルホネート、アルキルベンゼンスルホネート、リグノスルホン酸ナトリウム、2, 2'-ジナフチルメタン-6, 6'-ジスルホン酸ナトリウム、ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウムまたはナトリウムオレオイルメチルタウレートなども含んでいる。水和剤（粉末）を製造するためには、例えば、ハンマーミル、ブローミルおよびエアージェットミルなどの慣習的な装置の中で、活性除草性成分を微粉碎し、そして、同時にまたはその後で、製剤補助剤と混合する。

10

【0109】

乳剤（E m u l s i f i a b l e c o n c e n t r a t e s）は、活性成分を有機溶媒（例えば、ブタノール、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、キシレンまたは比較的沸点が高い芳香族物質もしくは炭化水素）またはそのような有機溶媒の混合物の中に溶解させ、イオン性および／または非イオン性の1種類以上の界面活性剤（乳化剤）を添加することによって製造する。使用し得る乳化剤の例は、以下のとおりである：アルキルアリールスルホン酸カルシウム、例えばドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム、または、非イオン性乳化剤、例えば、脂肪酸ポリグリコールエステル、アルキルアリールポリグリコールエーテル、脂肪族アルコールポリグリコールエーテル、プロピレンオキシド-エチレンオキシド縮合物、アルキルポリエーテル、ソルビタンエステル、例えば、ソルビタン脂肪酸エステル、または、ポリオキシエチレンソルビタンエステル、例えば、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル。

20

【0110】

粉剤（D u s t i n g p r o d u c t s）は、活性成分を微粉碎された（f i n e l y d i s t r i b u t e d）固形物（例えば、タルク、自然粘土、例えば、カオリン、ベントナイトおよび葉ろう石、または、珪藻土）と一緒に粉碎することによって得られる。

30

【0111】

サスペンション剤（S u s p e n s i o n c o n c e n t r a t e s）は、水性ベースまたは油性ベースであることができる。それらは、例えば、標準商業用ビーズミルを用いて、そして、場合により界面活性剤（例えば、製剤の別のタイプに関して既に上記で挙げられている界面活性剤）を添加して、湿式粉碎することによって製造することができる。

40

【0112】

エマルション（E m u l s i o n s）、例えば、水性エマルション（E W）は、例えば、水性有機溶媒を使用し、そして、場合により界面活性剤（例えば、別の製剤型に関して既に上記で挙げられている界面活性剤）を使用して、攪拌機、コロイドミルおよび／またはスティックミキサーを用いて調製することができる。

【0113】

粒剤（G r a n u l e s）は、吸着性である粒状不活性物質の表面上に活性成分を噴霧することによって、または、担体物質（例えば、砂、カオリナイトまたは粒状の不活性物質）の表面上に接着剤（例えば、ポリビニルアルコール、ポリアクリル酸ナトリウムまたは鉱油）を用いて活性成分濃厚物を塗布することによって、製造することができる。さら

50

にまた、肥料粒剤を製造するための慣習的な方法で（必用に応じて、肥料との混合物として）、好適な活性成分を造粒することも可能である。

【0114】

顆粒水和剤（Water-dispersible granules）は、一般に、噴霧乾燥、流動床造粒、パン造粒、高速ミキサーを用いた混合、および、固形不活性物質を用いない押出などの、慣習的な方法によって製造する。

【0115】

パン粒剤、流動床粒剤、押出粒剤および噴霧粒剤の製造に関しては、例えば、「Spray-Drying Handbook」第3版，1979，G. Goodwin Ltd.，London；J. E. Browning，「Agglomeration」，Chemical and Engineering 1967，147ページ ff.；「Perry's Chemical Engineer's Handbook」，第5版，McGraw Hill，New York 1973，8-57ページに記載されている方法を参照されたい。

【0116】

作物保護剤の製剤に関するさらなる詳細については、例えば、G. C. Klingman，「Weed Control as a Science」，John Wiley and Sons，Inc.，New York，1961，81-96ページおよびJ. D. Freyer，S. A. Evans，「Weed Control Handbook」，第5版，Blackwell Scientific Publications，Oxford，1968，101-103ページを参照されたい。

【0117】

本発明の農薬調製物、好ましくは除草性組成物または植物成長調節組成物は、好ましくは総量の0.1～99重量%、好ましくは0.5～95重量%、より好ましくは1～90重量%、特に好ましくは2～80重量%の一般式（I）の活性成分およびその塩を含んでいる。

【0118】

水和剤（粉末）において、活性成分の濃度は、例えば、約10重量%～90重量%であり、100重量%までの残余は、慣習的な製剤成分からなる。乳化可能な濃縮物において、活性成分の濃度は、約1重量%～90重量%、好ましくは、5重量%～80重量%であり得る。粉末の形態にある製剤は、1重量%～30重量%の活性成分、好ましくは、通常、5重量%～20重量%の活性成分を含み；噴霧可能な溶液は、約0.05重量%～80重量%、好ましくは、2重量%～50重量%の活性成分を含む。顆粒水和剤において、活性成分の含有量は、その活性成分が液体形態で存在しているかまたは固体形態で存在しているかに、および、どのような造粒助剤、増量剤などが使用されるかに部分的に依存する。顆粒水和剤において、活性成分の含有量は、例えば、1重量%～95重量%、好ましくは、10重量%～80重量%である。

【0119】

さらに、活性成分の上記製剤は、任意に、それぞれの慣習的な粘着剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、浸透剤、防腐剤、不凍剤、ならびに、溶媒、増量剤、担体、ならびに、色素、消泡剤、蒸発抑制剤、ならびに、pHおよび粘度に影響を及ぼす作用剤を含有する。製剤補助剤の例は、とりわけ、「Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations」，編D. A. Knowles，Kluwer Academic Publishers（1998）に記載されている。

【0120】

一般式（I）の本発明の化合物またはその塩は、そのまま、または他の農薬活性物質、例えば殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤、殺真菌剤、薬害軽減剤、肥料および／または成長調節剤と組み合わせたそれらの調製物（製剤）の形態で、例えば完成製剤またはタンクミックスの形態で使用することができる。組み合わせ製剤は、組み合わせる活性成分の物理的性質および安定性を考慮して、上述の製剤に基づいて製造することができる。

【0121】

混合製剤またはタンクミックスにおいて一般式（I）の本発明の化合物と使用することができる組合せパートナーは、例えば、Weed Research 26（1986）441-445または「The Pesticide Manual」，第16版，The British Crop Protection CouncilおよびRoyal Soc. of Chemistry，2012およびそこに引用されている文献に記載されているような、例えば、アセトラクテートシンターゼ、アセチル-CoAカルボキシラーゼ、セルロースシンターゼ、エノールピルビルシキメート-3-ホスフェートシンターゼ、グルタミンシンセターゼ、p-ヒドロキシフェニルピルベートジオキシゲナーゼ、フィトエンデサチュラーゼ、光化学系I、光化学系II、プロトポルフィリノゲンオキシダーゼの阻害に基づく公知の活性成分である。

10

【0122】

特に興味深いのは、有用植物の作物および観賞用植物中での有害植物の選択的防除である。一般式（I）の本発明の化合物は多数の作物において、非常に良好から十分な選択性を既に示しているが、原則として、いくつかの作物において、特に他の選択性の低い除草剤との混合物の場合に、作物植物に対する植物毒性が生じ得る。これに関連して、特に興味深い本発明の一般式（I）の化合物の組み合わせは、一般式（I）の化合物を含むもの、または他の除草剤もしくは農薬および薬害軽減剤とのそれらの組み合わせである。解毒に有効な量で使用される薬害軽減剤は、例えば、穀類（コムギ、オオムギ、ライムギ、トウモロコシ、イネ、キビ）、テンサイ、サトウキビ、アブラナ、ワタおよびダイズ、好ましくは穀類などの経済的に重要な作物において使用される除草剤／農薬の植物毒性副作用を低減する。

20

【0123】

除草剤（混合物）の薬害軽減剤に対する重量比は一般に、除草剤の施用量および問題の薬害軽減剤の効力に依存し、広い範囲内で、例えば、200：1～1：200、好ましくは100：1～1：100、特に20：1～1：20の範囲で変化し得る。一般式（I）の化合物またはそれらの混合物と類似して、薬害軽減剤は、さらなる除草剤／農薬と共に製剤化され得、そして最終製剤または除草剤とのタンクミックスとして提供され、そして使用され得る。

【0124】

施用のために、市販の形態における除草剤製剤または除草剤-薬害軽減剤製剤は適切であれば、通常の方法で希釈され、例えば、水和剤（粉末）、乳剤、分散剤および顆粒水和剤の場合には、水で希釈される。粉剤型の調製物、土壌施用用粒剤、または散布用粒剤および噴霧可能な溶液は、通常、施用前に他の不活性物質でさらに希釈されない。

30

【0125】

一般式（I）の化合物および／またはその塩の施用量は、温度、湿度などの外部条件によってある程度影響される。施用量は、広い範囲内で変化し得る。有害植物を防除するための除草剤としての施用のために、一般式（I）の化合物およびその塩の総量は、好ましくは0.001～10.0 kg/haの範囲、好ましくは0.005～5 kg/haの範囲、より好ましくは0.01～1.5 kg/haの範囲、特に好ましくは0.05～1 kg/haの範囲である。これは、出芽前および出芽後の施用の両方に適用される。

40

【0126】

一般式（I）の本発明の化合物および／またはその塩が植物成長調節剤として、例えば、上記のような作物植物、好ましくはコムギ、オオムギ、ライムギ、ライコムギ、キビ、イネまたはトウモロコシのような穀物植物のための稈（culm）安定剤として使用される場合、総施用量は、好ましくは0.001～2 kg/haの範囲、好ましくは0.005～1 kg/haの範囲、特に10～500 g/haの範囲、非常に特に好ましくは20～250 g/haの範囲である。これは、出芽前および出芽後の施用の両方に適用される。

【0127】

50

稈安定剤としての施用は、植物の成長の種々の段階で行うことができる。好ましいのは、例えば、分けつ期の後、縦成長の開始時に施用することである。

【0128】

代替として、植物成長調節剤としての施用もまた、種子を処理することによって可能であり、これには、種子を紛衣し、コーティングするための種々の技術が含まれる。施用量は特定の技術に依存し、予備試験で決定することができる。

【0129】

本発明の組成物において（例えば、混合製剤において、またはタンクミックスにおいて）、一般式（I）の本発明の化合物と使用することができる組合せパートナーは、例えば、Weed Research 26 (1986) 441-445または「The Pesticide Manual」, 第16版, The British Crop Protection CouncilおよびRoyal Soc. of Chemistry, 2012およびそこに引用されている文献に記載されているような、例えば、アセトラクテートシンターゼ、アセチル-CoAカルボキシラーゼ、セルロースシンターゼ、エノールピルビルシキメート-3-ホスフェートシンターゼ、グルタミンシンセターゼ、p-ヒドロキシフェニルピルベートジオキシゲナーゼ、フィトエンデサチュラーゼ、光化学系I、光化学系II、またはプロトポルフィリノゲンオキシダーゼの阻害に基づく公知の活性成分である。本発明の化合物と組み合わせることができる公知の除草剤または植物成長調節剤は、例えば、以下の活性化合物であり、ここで、該活性成分は、国際標準化機構（ISO）に従うそれらの「一般名」または化学名またはコード番号のいずれかで称される。それらは、常に全ての使用形態、例えば、酸、塩、エステルを包含し、および、たとえ明確に言及されていなくても、立体異性体および光学異性体のような全ての異性体形態を包含する。

【0130】

そのような除草性混合パートナーの例は、以下のものである：

アセトクロル、アシフルオルフェン、アシフルオルフェン-ナトリウム、アクロニフェン、アラクロール、アリドクロール、アロキシジム、アロキシジム-ナトリウム、アメトリン、アミカルバゾン、アミドクロル、アミドスルフロン、4-アミノ-3-クロロ-6-（4-クロロ-2-フルオロ-3-メチルフェニル）-5-フルオロピリジン-2-カルボン酸、アミノシクロピラクロル、アミノシクロピラクロル-カリウム、アミノシクロピラクロル-メチル、アミノピラリド、アミトロール、スルファミン酸アンモニウム、アニロホス、アスラム、アトラジン、アザフェニジン、アジムスルフロン、ベフルブタミド、ベナゾリン、ベナゾリン-エチル、ベンフルラリン、ベンフレセート、ベンスルフロン、ベンスルフロン-メチル、ベンスリド、ベントゾン、ベンゾビシクロン、ベンゾフェナップ、ビシクロピロン、ビフェノックス、ピラナホス、ピラナホス-ナトリウム、ビスピリバック、ビスピリバック-ナトリウム、プロマシル、プロモブチド、プロモフェノキシム、プロモキシニル、プロモキシニル-ブチレート、-カリウム、-ヘプタノエートおよび-オクタノエート、ブソキシノン、ブタクロール、ブタフェナシル、ブタミホス、ブテナクロール、ブトラリン、ブトロキシジム、ブチレート、カフェンストロール、カルベタミド、カルフェントラゾン、カルフェントラゾン-エチル、クロランベン、クロルブロムロン、クロルフェナク、クロルフェナク-ナトリウム、クロルフェンプロップ、クロルフルレノール、クロルフルレノール-メチル、クロリダゾン、クロリムロン、クロリムロン-エチル、クロロフタリム、クロロトルロン、クロルタール-ジメチル、クロルスルフロン、シニドン、シニドン-エチル、シンメチリン、シノスルフロン、クラシホス、クレトジム、クロジナホップ、クロジナホップ-プロパルギル、クロマゾン、クロメプロップ、クロピラリド、クロランスラム、クロランスラム-メチル、クミルロン、シアナミド、シアナジン、シクロエート、シクロピリモレート、シクロスルファミロン、シクロキシジム、シハロホップ、シハロホップ-ブチル、シブラジン、2, 4-D、2, 4-D-ブトチル、-ブチル、-ジメチルアンモニウム、-ジオラミン、-エチル、2-エチルヘキシル、-イソブチル、-イソオクチル、-イソプロピルアンモニウム、-カリウム、-トリイソ

プロパノールアンモニウムおよびートロラミン、2, 4-DB、2, 4-DB-ブチル、
 -ジメチルアンモニウム、-イソオクチル、-カリウムおよび-ナトリウム、ダイムロン
 (daimuron) (dymron)、ダラボン、ダゾメット、n-デカノール、デス
 メジファミ、デトシル-ピラゾレート (DTP)、ジカンバ、ジクロベニル、2-(2,
 4-ジクロロベンジル)-4, 4-ジメチル-1, 2-オキサゾリジン-3-オン、2-(
 2, 5-ジクロロベンジル)-4, 4-ジメチル-1, 2-オキサゾリジン-3-オン
 、ジクロルプロップ、ジクロルプロップ-P、ジクロホップ、ジクロホップ-メチル、ジ
 クロホップ-P-メチル、ジクロスラム、ジフェンゾコート、ジフルフェニカン、ジフル
 フェンゾピル、ジフルフェンゾピル-ナトリウム、ジメフロン、ジメピペレート、ジメタ
 クロール、ジメタメトリン、ジメテナミド、ジメテナミド-P、ジメトラスルフロン、ジ
 ニトラミン、ジノテルブ、ジフェナミド、ジクワット、ジクワット-ジブロミド、ジチオ
 ピル、ジウロン、DNOC、エンドタール、EPTC、エスプロカルブ、エタルフルラリ
 ン、エタメトスルフロン、エタメトスルフロン-メチル、エチオジン、エトフメセート、
 エトキシフェン、エトキシフェン-エチル、エトキシスルフロン、エトベンザニド、F-
 9600、F-5231、すなわち、N-[2-クロロ-4-フルオロ-5-[4-(3-
 フルオロプロピル)-4, 5-ジヒドロ-5-オキソ-1H-テトラゾール-1-イル
]-フェニル]-エタンスルホンアミド、F-7967、すなわち、3-[7-クロロ-
 5-フルオロ-2-(トリフルオロメチル)-1H-ベンゾイミダゾール-4-イル]-
 1-メチル-6-(トリフルオロメチル)ピリミジン-2, 4(1H, 3H)-ジオン、
 フェノキサプロップ、フェノキサプロップ-P、フェノキサプロップ-エチル、フェノキ
 サプロップ-P-エチル、フェノキサスルホン、フェンキノトリオン、フェントラザミド
 、フラムプロップ、フラムプロップ-M-イソプロピル、フラムプロップ-M-メチル、
 フラザスルフロン、フロラスラム、フルアジホップ、フルアジホップ-P、フルアジホッ
 プ-ブチル、フルアジホップ-P-ブチル、フルカルバゾン、フルカルバゾン-ナトリウ
 ム、フルセトスルフロン、フルクロラリン、フルフェナセット、フルフェンピル、フルフ
 ェンピル-エチル、フルメツラム、フルミクロラック、フルミクロラック-ペンチル、フル
 ミオキサジン、フルオメツロン、フルレノール、フルレノール-ブチル、-ジメチルア
 ンモニウムおよび-メチル、フルオログリコフェン、フルオログリコフェン-エチル、フル
 プロパネート、フルビルスルフロン、フルビルスルフロン-メチル-ナトリウム、フル
 リドン、フルロクロリドン、フルロキシピル、フルロキシピル-メプチル、フルルタモン
 、フルチアセット、フルチアセット-メチル、ホメサフェン、ホメサフェン-ナトリウム
 、ホラムスルフロン、ホサミン、グルホシネート、グルホシネート-P-ナトリウム、グル
 ホシネート-P-アンモニウム、グルホシネート-P-ナトリウム、グリホセート、グリ
 ホセート-アンモニウム、-イソプロピルアンモニウム、-ジアンモニウム、-ジメチ
 ルアンモニウム、-カリウム、-ナトリウムおよび-トリメシウム、H-9201、すな
 わち、O-(2, 4-ジメチル-6-ニトロフェニル)O-エチル-イソプロピルホスホ
 ルアミドチオエート、ハラウキシフェン、ハラウキシフェン-メチル、ハロサフェン、ハ
 ロスルフロン、ハロスルフロン-メチル、ハロキシホップ、ハロキシホップ-P、ハロキ
 シホップ-エトキシエチル、ハロキシホップ-P-エトキシエチル、ハロキシホップ-メ
 チル、ハロキシホップ-P-メチル、ヘキサジノン、HW-02、すなわち、1-(ジメ
 トキシホスホリル)エチル(2, 4-ジクロロフェノキシ)アセテート、ヒダントサイジ
 ン、イマザメタベンズ、イマザメタベンズ-メチル、イマザモックス、イマザモックス-
 アンモニウム、イマザピック、イマザピック-アンモニウム、イマザピル、イマザピル-
 イソプロピルアンモニウム、イマザキン、イマザキン-アンモニウム、イマゼタピル、イ
 マゼタピル-イモニウム (immonium)、イマゾスルフロン、インダノファン、イン
 ダジフラム、ヨードスルフロン、ヨードスルフロン-メチル-ナトリウム、アイオキシ
 ニル、アイオキシニル-オクタノエート、-カリウムおよび-ナトリウム、イプフェンカル
 バゾン、イソプロツロン、イソウロン、イソキサベン、イソキサフルトール、カルブチレ
 ート、KUH-043、すなわち、3-({[5-(ジフルオロメチル)-1-メチル-
 3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-イル]メチル}スルホニル)-5

10

20

30

40

50

, 5-ジメチル-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール、ケトスピラドックス、ラク
 トフェン、レナシル、リニュロン、MCPA、MCPA-ブトチル、-ジメチルアンモニ
 ウム、-2-エチルヘキシル、-イソプロピルアンモニウム、-カリウムおよび-ナトリ
 ウム、MCPB、MCPB-メチル、-エチルおよびナトリウム、メコプロップ、メコプ
 ロップ-ナトリウム、およびメコプロップ-ブトチル、メコプロップ-P、メコプロップ
 -P-ブトチル、-ジメチルアンモニウム、-2-エチルヘキシルおよび-カリウム、メ
 フェナセット、メフルイジド、メソスルフロソ、メソスルフロソ-メチル、メソトリオン
 、メタベンズチアズロン、メタム、メタミホップ、メタミトロン、メタザクロール、メタ
 ゾスルフロソ、メタベンズチアズロン、メチオピルスルフロソ (methiopyrsul
 furon)、メチオゾリン、イソチオシアン酸メチル、メトブロムロン、メトラクロ
 ール、S-メトラクロール、メトスラム、メトクスロン、メトリブジン、メトスルフロソ
 、メトスルフロソ-メチル、モリネート、モノリニュロン、モノスルフロソ、モノスルフ
 ロソ-エステル、MT-5950、すなわち、N-[3-クロロ-4-(1-メチルエチ
 ル)フェニル]-2-メチルペンタンアミド、NGGC-011、ナプロパミド、NC-
 310、すなわち、4-(2, 4-ジクロロベンゾイル)-1-メチル-5-ベンジルオ
 キスピラゾール、ネブロン、ニコスルフロソ、ノナン酸 (ペラルゴン酸)、ノルフルラゾ
 ン、オレイン酸 (脂肪酸)、オルベンカルブ、オルソスルファミロン、オリザリン、オキ
 サジアルギル、オキサジアゾン、オキサスルフロソ、オキサジクロメフォン、オキシフル
 オルフェン、パラコート、パラコート-ジクロリド、ペブレート、ペンジメタリン、ペノ
 キススラム、ペンタクロロフェノール、ペントキサゾン、ペトキサミド、石油、フェンメ
 ジファミ、ピクロラム、ピコリナフェン、ピノキサデン、ピペロホス、プレチラクロール
 、プリミスルフロソ、プリミスルフロソ-メチル、プロジアミン、プロホキシジウム、プロ
 メトン、プロメトリン、プロパクロール、プロパニル、プロパキサホップ、プロパジン、
 プロファミ、プロビスクロール、プロボキシカルバゾン、プロボキシカルバゾン-ナトリ
 ウム、プロピリスルフロソ、プロピザミド、プロスルホカルブ、プロスルフロソ、ピラク
 ロニル、ピラフルフェン、ピラフルフェン-エチル、ピラスルホトール、ピラゾリネート
 (ピラゾレート)、ピラゾスルフロソ、ピラゾスルフロソ-エチル、ピラゾキシフェン、
 ピリバムベンズ (pyribambenz)、ピリバムベンズ-イソプロピル、ピリバム
 ベンズ-ブトチル、ピリベンゾキシム、ピリブチカルブ、ピリダフォル、ピリデート、ピ
 リフタリド、ピリミノバック、ピリミノバック-メチル、ピリミスルファン、ピリチオバ
 ック、ピリチオバック-ナトリウム、ピロキサスルホン、ピロキシスラム、キンクロラッ
 ク、キンメラック、キノクラミン、キサロホップ、キサロホップ-エチル、キサロホップ
 -P、キサロホップ-P-エチル、キサロホップ-P-テフリル、リムスルフロソ、サフ
 ルフェナシル、セトキシジウム、シデュロン、シマジン、シメトリン、SL-261、スル
 コトリオン、スルフェントラゾン、スルホメツロン、スルホメツロン-メチル、スルホス
 ルフロソ、SYN-523、SYP-249、すなわち、1-エトキシ-3-メチル-1
 -オキサブタ-3-エン-2-イル-5-[2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フ
 ェノキシ]-2-ニトロベンゾエート、SYP-300、すなわち、1-[7-フルオロ
 -3-オキソ-4-(プロパ-2-イン-1-イル)-3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4
 -ベンゾオキサジン-6-イル]-3-ブトチル-2-チオキソイミダゾリジン-4, 5
 -ジオン、2, 3, 6-TBA、TCA (トリフルオロ酢酸)、TCA-ナトリウム、テ
 ブチウロン、テフリルトリオン、テンボトリオン、テブラロキシジウム、ターバシル、テル
 ブカルブ、テルブメトン、テルブチラジン、テルブトリン、テニルクロール、チアゾピル
 、チエンカルバゾン、チエンカルバゾン-メチル、チフェンスルフロソ、チフェンスルフ
 ロソ-メチル、チオベンカルブ、チアフェナシル、トルピラレート、トブラメゾン、トラ
 ルコキシジウム、トリアファモン、トリアレート、トリアスルフロソ、トリアジフラム、ト
 リベヌロン、トリベヌロン-メチル、トリクロピル、トリエタジン、トリフロキシスルフ
 ロソ、トリフロキシスルフロソ-ナトリウム、トリフルジモキサジン、トリフルラリン、
 トリフルスルフロソ、トリフルスルフロソ-メチル、トリトスルフロソ、尿素硫酸塩、ベ
 ルノレート、XDE-848、ZJ-0862、すなわち、3, 4-ジクロロ-N-{2

10

20

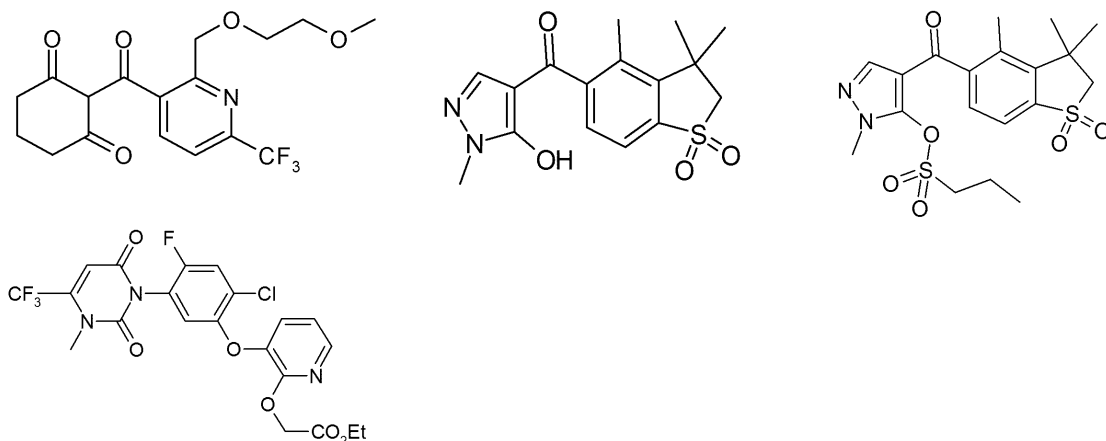
30

40

50

ー〔(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)オキシ〕ベンジル〕アニリン、ならびに以下の化合物：

【化 1 1】



10

【0 1 3 1】

可能な混合パートナーとしての植物成長調節剤の例は、以下のものである：

アシベンゾラル、アシベンゾラル-S-メチル、5-アミノレブリン酸、アンシミドール、6-ベンジルアミノプリン、ブラシノリド、カテコール、クロルメコートクロリド、クロプロップ、シクラニリド、3-(シクロプロパー-1-エニル)プロピオン酸、ダミノジド、ダゾメット、n-デカノール、ジケグラック、ジケグラック-ナトリウム、エンドタール、エンドタール-ジカリウム、-ジナトリウム、およびモノ(N, N-ジメチルアルキルアンモニウム)、エテホン、フルメトラリン、フルレノール、フルレノール-ブチル、フルプリミドール、ホルクロルフェニユロン、ジベレリン酸、イナベンフィド、インドール-3-酢酸(IAA)、4-インドール-3-イル酪酸、イソプロチオラン、プロベナゾール、ジャスモン酸、ジャスモン酸メチルエステル、マレイン酸ヒドラジド、メピコートクロリド、1-メチルシクロプロペン、1-メチルシクロプロペン、2-(1-ナフチル)アセトアミド、1-ナフチル酢酸、2-ナフチルオキシ酢酸、ニトロフェノール混合物、4-オキソ-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]酪酸、パクロブトラゾール、N-フェニルフタルアミド酸、プロヘキサジオン、プロヘキサジオン-カルシウム、プロヒドロジャスモン、サリチル酸、ストリゴラクトン、テクナゼン、チジアズロン、トリアコンタノール、トリネキサパック、トリネキサパック-エチル、チトデフ(t s i t o d e f)、ウニコナゾール、ウニコナゾール-P。

20

30

【0 1 3 2】

一般式(I)の本発明の化合物の有用な組合せパートナーには、例えば、以下の薬害軽減剤も含まれる：

S 1) 複素環式カルボン酸誘導体の群からの化合物：

S 1^a) ジクロロフェニルピラゾリン-3-カルボン酸型の化合物(S 1^a)、好ましくは、以下のような化合物：

1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-(エトキシカルボニル)-5-メチル-2-ピラゾリン-3-カルボン酸、1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-(エトキシカルボニル)-5-メチル-2-ピラゾリン-3-カルボン酸エチル(S 1-1)、「メフェンビル-ジエチル」および関連化合物(これらは、WO-A-91/07874に記載されている)；

40

S 1^b) ジクロロフェニルピラゾールカルボン酸の誘導体(S 1^b)、好ましくは、以下のような化合物：

1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-メチルピラゾール-3-カルボン酸エチル(S 1-2)、1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-イソプロピルピラゾール-3-カルボン酸エチル(S 1-3)、1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-(1, 1-ジメチ

50

ルエチル)ピラゾール-3-カルボン酸エチル(S 1-4)および関連化合物(これらは、EP-A-333131およびEP-A-269806に記載されている)；

S 1^c) 1, 5-ジフェニルピラゾール-3-カルボン酸の誘導体(S 1^c)、好ましくは、以下のような化合物：

1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-フェニルピラゾール-3-カルボン酸エチル(S 1-5)、1-(2-クロロフェニル)-5-フェニルピラゾール-3-カルボン酸メチル(S 1-6)および関連化合物(これらは、例えば、EP-A-268554に記載されている)；

S 1^d) トリアゾールカルボン酸型の化合物(S 1^d)、好ましくは、以下のような化合物：

フェンクロラゾール(-エチルエステル)、すなわち、1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-トリクロロメチル-(1H)-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボン酸エチル(S 1-7)および関連化合物(これらは、EP-A-174562およびEP-A-346620に記載されている)；

S 1^e) 5-ベンジル-もしくは5-フェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸または5, 5-ジフェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸型の化合物(S 1^e)、好ましくは、以下のような化合物：5-(2, 4-ジクロロベンジル)-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸エチル(S 1-8)もしくは5-フェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸エチル(S 1-9)および関連化合物(これらは、WO-A-91/08202に記載されている)、または、5, 5-ジフェニル-2-イソオキサゾリンカルボン酸(S 1-10)もしくは5, 5-ジフェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸エチル(S 1-11)('イソキサジフェン-エチル')もしくは5, 5-ジフェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸n-プロピル(S 1-12)もしくは5-(4-フルオロフェニル)-5-フェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸エチル(S 1-13)(これらは、特許出願WO-A-95/07897に記載されている)。

【0133】

S 2) 8-キノリンオキシ誘導体(S 2)の群からの化合物：

S 2^a) 8-キノリンオキシ酢酸型の化合物(S 2^a)、好ましくは、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸1-メチルヘキシル('クロキントセット-メキシル')(S 2-1)、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸1, 3-ジメチルブター-1-イル(S 2-2)、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸4-アリルオキシブチル(S 2-3)、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸1-アリルオキシプロパー-2-イル(S 2-4)、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸エチル(S 2-5)、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸メチル(S 2-6)、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸アリル(S 2-7)、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸2-(2-プロピリデンイミノオキシ)-1-エチル(S 2-8)、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸2-オキソプロパー-1-イル(S 2-9)および関連化合物(これらは、EP-A-86750、EP-A-94349およびEP-A-191736またはEP-A-0492366に記載されている)、ならびに、さらに、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸(S 2-10)、その水和物および塩、例えば、そのリチウム塩、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩、アルミニウム塩、鉄塩、アンモニウム塩、第4級アンモニウム塩、スルホニウム塩またはホスホニウム塩(これらは、WO-A-2002/34048に記載されている)；

S 2^b) (5-クロロ-8-キノリンオキシ)マロン酸型の化合物(S 2^b)、好ましくは、以下のような化合物：(5-クロロ-8-キノリンオキシ)マロン酸ジエチル、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)マロン酸ジアリル、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)マロン酸メチルエチルおよび関連化合物(これらは、EP-A-0582198に記載されている)。

【0134】

10

20

30

40

50

S 3) 出芽前薬害軽減剤（土壌作用性薬害軽減剤）としてしばしば使用されるジクロロアセトアミド型の活性成分（S 3）、例えば、

「ジクロルミド」（N，N－ジアリル－2，2－ジクロロアセトアミド）（S 3－1）、
「R－2 9 1 4 8」（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）〔Staufferから〕（S 3－2）、

「R－2 8 7 2 5」（3－ジクロロアセチル－2，2－ジメチル－1，3－オキサゾリジン）〔Staufferから〕（S 3－3）、

「ベノキサコル」（4－ジクロロアセチル－3，4－ジヒドロ－3－メチル－2 H－1，4－ベンゾオキサジン）（S 3－4）、

「PPG－1 2 9 2」（N－アリル－N－〔（1，3－ジオキサラン－2－イル）メチル〕ジクロロアセトアミド）〔PPG Industriesから〕（S 3－5）、

「DKA－2 4」（N－アリル－N－〔（アリルアミノカルボニル）メチル〕ジクロロアセトアミド）〔Sagro-Chemから〕（S 3－6）、

「AD－6 7」または「MON 4 6 6 0」（3－ジクロロアセチル－1－オキサ－3－アザスピロ〔4．5〕デカン）〔NitrokemiaまたはMonsantoから〕（S 3－7）、

「TI－3 5」（1－ジクロロアセチルアゼパン）〔TRI-Chemical RTから〕（S 3－8）、

「ジクロノン（Diclonon）」（ジシクロノン（Dicyclonon））または「BAS 1 4 5 1 3 8」または「LAB 1 4 5 1 3 8」（S 3－9）、

（（RS）－1－ジクロロアセチル－3，3，8a－トリメチルペルヒドロピロロ〔1，2－a〕ピリミジン－6－オン）〔BASFから〕、

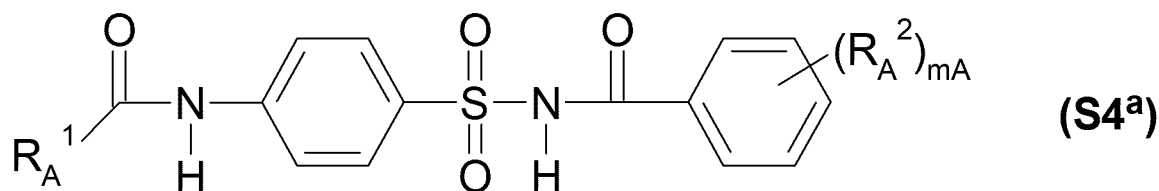
「フリラゾール」または「MON 1 3 9 0 0」（（RS）－3－ジクロロアセチル－5－（2－フリル）－2，2－ジメチルオキサゾリジン）（S 3－10）およびその（R）－異性体（S 3－11）。

〔0 1 3 5〕

S 4) アシルスルホンアミド（S 4）の群からの化合物：

S 4^a) 式（S 4^a）のN－アシルスルホンアミドおよびそれらの塩（これは、WO－A－9 7／4 5 0 1 6に記載されている）

〔化 1 2〕



〔式中、

R_A¹は、（C₁－C₆）－アルキル、（C₃－C₆）－シクロアルキルであり、ここで最後に挙げられている2つの基は、ハロゲン、（C₁－C₄）－アルコキシ、（C₁－C₆）－ハロアルコキシおよび（C₁－C₄）－アルキルチオからなる群から選択され、さらに、環式基の場合には、（C₁－C₄）－アルキルおよび（C₁－C₄）－ハロアルキルからなる群から選択されるv_Aの置換基で置換されており；

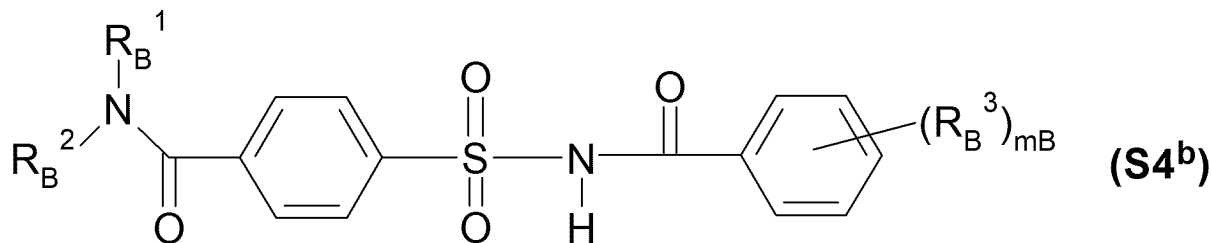
R_A²は、ハロゲン、（C₁－C₄）－アルキル、（C₁－C₄）－アルコキシ、CF₃であり；

m_Aは、1または2であり；

v_Aは、0、1、2または3である）；

S 4^b) 下記式（S 4^b）の4－（ベンゾイルスルファモイル）ベンズアミド型の化合物およびそれらの塩（これは、WO－A－9 9／1 6 7 4 4に記載されている）

【化 1 3】



〔式中、

10

R_B^1 、 R_B^2 は、独立して、水素、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_3 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_3 - C_6)$ - アルキニルであり、

R_B^3 は、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルまたは $(C_1 - C_4)$ - アルコキシであり、および

m_B は、1または2であり、

例えば、その式中、

R_B^1 = シクロプロピル、 R_B^2 = 水素および $(R_B^3) = 2 - OMe$ (「シプロスルファミド」、 $S4-1$)、

R_B^1 = シクロプロピル、 R_B^2 = 水素および $(R_B^3) = 5 - Cl - 2 - OMe$ ($S4-2$)、

20

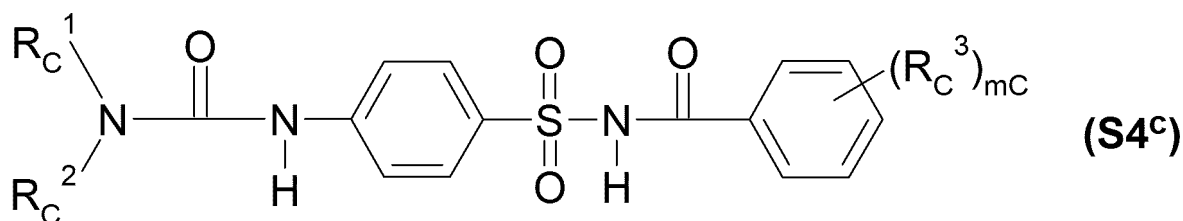
R_B^1 = エチル、 R_B^2 = 水素および $(R_B^3) = 2 - OMe$ ($S4-3$)、

R_B^1 = イソプロピル、 R_B^2 = 水素および $(R_B^3) = 5 - Cl - 2 - OMe$ ($S4-4$) および

R_B^1 = イソプロピル、 R_B^2 = 水素および $(R_B^3) = 2 - OMe$ ($S4-5$) ;

$S4^c$) 式 ($S4^c$) のベンゾイルスルファモイルフェニル尿素のクラスからの化合物 (これらは、EP-A-365484に記載されている)、

【化 1 4】



30

〔式中、

R_C^1 、 R_C^2 は、独立して、水素、 $(C_1 - C_8)$ - アルキル、 $(C_3 - C_8)$ - シクロアルキル、 $(C_3 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_3 - C_6)$ - アルキニルであり、

R_C^3 は、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 CF_3 であり、および

40

m_C は、1または2である〕

例えば、

1 - [4 - (N - 2 - メトキシベンゾイルスルファモイル) フェニル] - 3 - メチル尿素 ;

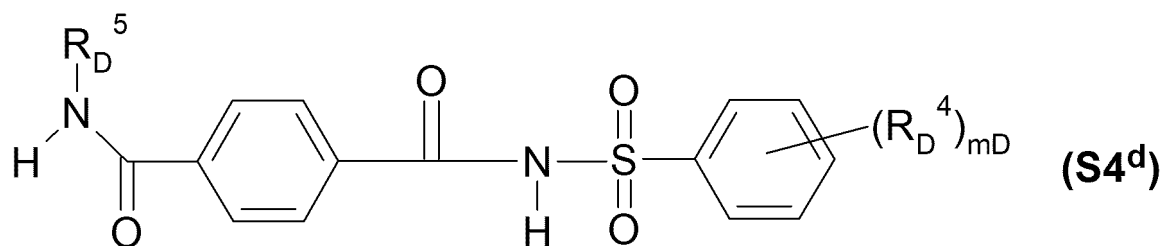
1 - [4 - (N - 2 - メトキシベンゾイルスルファモイル) フェニル] - 3, 3 - ジメチル尿素 ;

1 - [4 - (N - 4, 5 - ジメチルベンゾイルスルファモイル) フェニル] - 3 - メチル尿素 ;

$S4^d$) 式 ($S4^d$) の N - フェニルスルホニルテレフタルアミド型の化合物および

50

その塩（これらは、例えば、CN 101838227から知られている）、
【化15】



10

〔式中、
R_D⁴は、ハロゲン、(C₁－C₄)－アルキル、(C₁－C₄)－アルコキシ、CF₃であり；

m_Dは、1または2であり；

R_D⁵は、水素、(C₁－C₆)－アルキル、(C₃－C₆)－シクロアルキル、(C₂－C₆)－アルケニル、(C₂－C₆)－アルキニルまたは(C₅－C₆)－シクロアルケニルである〕。

【0136】

S5) ヒドロキシ芳香族化合物および芳香族－脂肪族カルボン酸誘導体のクラスから選択される活性成分(S5)、例えば、3,4,5-トリアセトキシ安息香酸エチル、3,5-ジメトキシ-4-ヒドロキシ安息香酸、3,5-ジヒドロキシ安息香酸、4-ヒドロキシサリチル酸、4-フルオロサリチル酸(4-fluorosalicylic acid)、2-ヒドロキシケイ皮酸、2,4-ジクロロケイ皮酸（これらは、WO-A-2004/084631、WO-A-2005/015994、WO-A-2005/016001に記載されている）。

20

【0137】

S6) 1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オン類のクラスから選択される活性成分(S6)、例えば、1-メチル-3-(2-チエニル)-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オン、1-メチル-3-(2-チエニル)-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-チオン、1-(2-アミノエチル)-3-(2-チエニル)-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オン塩酸塩、1-(2-メチルスルホニルアミノエチル)-3-(2-チエニル)-1,2-ジヒドロキノキサリン-2-オン（これらは、WO-A-2005/112630に記載されている）。

30

【0138】

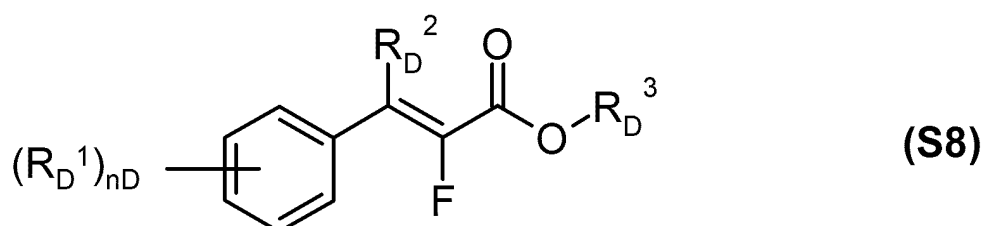
S7) ジフェニルメトキシ酢酸誘導体(S7)のクラスからの化合物、例えば、メチルジフェニルメトキシアセテート(CAS Reg. No. 41858-19-9)(S7-1)、エチルジフェニルメトキシアセテートまたはジフェニルメトキシ酢酸（これらは、WO-A-98/38856に記載されている）。

【0139】

S8) 式(S8)の化合物（これは、WO-A-98/27049に記載されている）。

40

【化16】



50

〔式中、記号およびインデックスは、以下のように定義される：

R_D^1 は、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシであり、

R_D^2 は、水素または $(C_1 - C_4)$ - アルキルであり、

R_D^3 は、水素、 $(C_1 - C_8)$ - アルキル、 $(C_2 - C_4)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_4)$ - アルキニルまたはアリールであり、ここで、上記の炭素含有基は、それぞれ、置換されていないか、または、ハロゲンおよびアルコキシからなる群から選択される 1 以上の、好ましくは、最大で 3 つまでの、同一であるかもしくは異なっている基で置換されており、またはその塩であり、

n_D は、0 ~ 2 の整数である〕。

10

【0140】

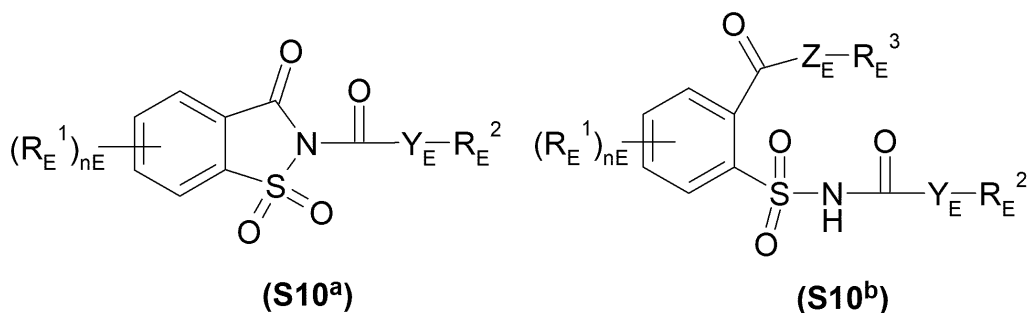
S9) 3 - (5 - テトラゾリルカルボニル) - 2 - キノロン類のクラスから選択される活性成分 (S9)、例えば、1, 2 - ジヒドロ - 4 - ヒドロキシ - 1 - エチル - 3 - (5 - テトラゾリルカルボニル) - 2 - キノロン (CAS Reg. No. 219479 - 18 - 2)、1, 2 - ジヒドロ - 4 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 3 - (5 - テトラゾリルカルボニル) - 2 - キノロン (CAS Reg. No. 95855 - 00 - 8) (これらは、WO - A - 1999 / 000020 に記載されている)。

【0141】

S10) 式 (S10^a) または式 (S10^b) の化合物 (これらは、WO - A - 2007 / 023719 および WO - A - 2007 / 023764 に記載されている)、

20

【化17】



30

〔式中、

R_E^1 は、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、メトキシ、ニトロ、シアノ、 CF_3 、 OCF_3 であり、

Y_E 、 Z_E は、独立して、O または S であり、

n_E は、0 ~ 4 の整数であり、

R_E^2 は、 $(C_1 - C_{16})$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、アリール、ベンジル、ハロベンジルであり、

R_E^3 は、水素または $(C_1 - C_6)$ - アルキルである〕。

【0142】

40

S11) オキシイミノ化合物型の活性成分 (S11)、これらは、種子紛衣剤として知られており、例えば、

「オキサベトリニル」((Z) - 1, 3 - ジオキサラン - 2 - イルメトキシイミノ (フェニル) アセトニトリル) (S11 - 1) (これは、メトラクロールによる損傷に対するキビ / モロコシ用の種子紛衣薬害軽減剤として知られている)、

「フルキシフェニム」(1 - (4 - クロロフェニル) - 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - エタノン O - (1, 3 - ジオキサラン - 2 - イルメチル) オキシム) (S11 - 2) (これは、メトラクロールによる損傷に対するキビ / モロコシ用の種子紛衣薬害軽減剤として知られている)、および、

「シオメトリニル」または「CGA - 43089」((Z) - シアノメトキシイミノ (

50

フェニル) アセトニトリル) (S 1 1 - 3) (これは、メトラクロールによる損傷に対するキビ／モロコシ用の種子紛衣薬害軽減剤として知られている)。

【0 1 4 3】

S 1 2) イソチオクロマノン類のクラスから選択される活性成分 (S 1 2)、例えば、[(3-オキソ-1H-2-ベンゾチオピラン-4(3H)-イリデン)メトキシ]酢酸メチル (CAS Reg. No. 2 0 5 1 2 1 - 0 4 - 6) (S 1 2 - 1) および関連化合物 (WO-A-1 9 9 8 / 1 3 3 6 1)。

【0 1 4 4】

S 1 3) 以下の群から選択される1つ以上の化合物 (S 1 3)：

「ナフタル酸無水物」(1, 8-ナフタレンジカルボン酸無水物) (S 1 3 - 1)、これは、チオカーバメート系除草剤による損傷に対するトウモロコシ用の種子紛衣薬害軽減剤として知られている；

「フェンクロリム」(4, 6-ジクロロ-2-フェニルピリミジン) (S 1 3 - 2)、これは、播種されたイネにおいてプレチクロールに対する薬害軽減剤として知られている；

「フルラゾール」(2-クロロ-4-トリフルオロメチル-1, 3-チアゾール-5-カルボン酸ベンジル) (S 1 3 - 3)、これは、アラクロールおよびメトラクロールによる損傷に対するキビ／モロコシ用の種子紛衣薬害軽減剤として知られている；

「CL 3 0 4 4 1 5」(CAS Reg. No. 3 1 5 4 1 - 5 7 - 8) (4-カルボキシ-3, 4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾピラン-4-酢酸) (S 1 3 - 4) (American Cyanamidから)、これは、イミダゾリノン類による損傷に対するトウモロコシ用の薬害軽減剤として知られている；

「MG 1 9 1」(CAS Reg. No. 9 6 4 2 0 - 7 2 - 3) (2-ジクロロメチル-2-メチル-1, 3-ジオキサラン) (S 1 3 - 5) (Nitrokemiaから)、これは、トウモロコシ用の薬害軽減剤として知られている；

「MG 8 3 8」(CAS Reg. No. 1 3 3 9 9 3 - 7 4 - 5) (2-プロペニル 1-オキサ-4-アザスピロ [4. 5] デカン-4-カルボジチオエート) (S 1 3 - 6) (Nitrokemiaから)；

「ジスルホトン」(O, O-ジエチル S-2-エチルチオエチル ホスホロジチオエート) (S 1 3 - 7)；

「ジエトレート (dietholate)」(O, O-ジエチル O-フェニルホスホロチオエート) (S 1 3 - 8)；

「メフェネート (mephenate)」(メチルカルバミン酸 4-クロロフェニル) (S 1 3 - 9)。

【0 1 4 5】

S 1 4) 有害植物に対する除草効果に加えて、イネなどの作物植物に対する薬害軽減効果も有している活性成分、例えば、

「ジメピレート」または「MY 9 3」(S-1-メチル 1-フェニルエチルピペリジン-1-カルボチオエート)、これは、除草剤モリネートによる損傷に対するイネ用の薬害軽減剤として知られている；

「ダイムロン」または「SK 2 3」(1-(1-メチル-1-フェニルエチル)-3-ポートリル尿素)、これは、除草剤イマゾスルフロンによる損傷に対するイネ用の薬害軽減剤として知られている；

「クミルロン」=「JC 9 4 0」(3-(2-クロロフェニルメチル)-1-(1-メチル-1-フェニルエチル)尿素、(JP-A-6 0 0 8 7 2 7 0を参照されたい)、これは、いくつかの除草剤による損傷に対するイネ用の薬害軽減剤として知られている；

「メトキシフェノン」または「NK 0 4 9」(3, 3'-ジメチル-4-メトキシベンゾフェノン)、これは、一部の除草剤による損傷に対するイネ用の薬害軽減剤として知られている；

「CSB」(1-ブロモ-4-(クロロメチルスルホニル)ベンゼン) (Kumiai

10

20

30

40

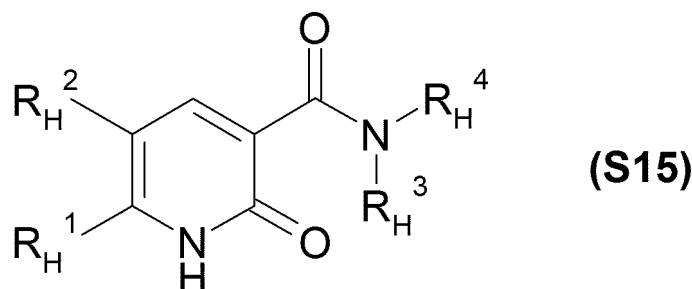
50

から) (CAS Reg. No. 54091-06-4)、これは、イネにおけるいくつかの除草剤による損傷に対する薬害軽減剤として知られている。

【0146】

S15) 式(S15)の化合物またはその互変異性体(これは、WO-A-2008/131861およびWO-A-2008/131860に記載されている)

【化18】



10

〔式中、

R_H^1 は、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル基であり、および、

R_H^2 は、水素またはハロゲンであり、および

R_H^3 、 R_H^4 は、それぞれ独立して、水素、 $(C_1 - C_{16})$ - アルキル、 $(C_2 - C_{16})$ - アルケニルまたは $(C_2 - C_{16})$ - アルキニルであり、

20

ここで、後ろに挙げられている3つのラジカルは、それぞれ、置換されていないか、またはハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルアミノ、ジ[$(C_1 - C_4)$ - アルキル]アミノ、[$(C_1 - C_4)$ - アルコキシ]カルボニル、[$(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ]カルボニル、置換されていないかもしくは置換されている $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、置換されていないかもしくは置換されているフェニルおよび置換されていないかもしくは置換されているヘテロシクリルの群から選択される1以上のラジカルで置換されており、

または $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_4 - C_6)$ - シクロアルケニル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル(ここで、該環は、当該環の1辺において4~6員の飽和または不飽和の炭素環式環に縮合している)または $(C_4 - C_6)$ - シクロアルケニル(ここで、該環は、当該環の1辺において4~6員の飽和または不飽和の炭素環式環に縮合している)であり、

30

ここで、後ろに挙げられている4つの基は、それぞれ、置換されていないか、または、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルアミノ、ジ[$(C_1 - C_4)$ - アルキル]アミノ、[$(C_1 - C_4)$ - アルコキシ]カルボニル、[$(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ]カルボニル、置換されていないかもしくは置換されている $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、置換されていないかもしくは置換されているフェニルおよび置換されていないかもしくは置換されているヘテロシクリルからなる群から選択される1以上のラジカルで置換されており；

40

または、

R_H^3 は、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_2 - C_4)$ - アルケニルオキシ、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニルオキシまたは $(C_2 - C_4)$ - ハロアルコキシであり；および、

R_H^4 は、水素または $(C_1 - C_4)$ - アルキルであり、または、

R_H^3 と R_H^4 は、直接結合している窒素原子と一緒にあって、4~8員のヘテロ環式環(ここで、該ヘテロ環式環は、当該窒素原子に加えて、さらなる環ヘテロ原子(好ましくは、N、OおよびSの群から選択される最大で2個までのさらなる環ヘテロ原子)も含

50

むことができ、また、該ヘテロ環式環は、置換されていないか、または、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -ハロアルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルコキシおよび (C_1-C_4) -アルキルチオの群から選択される1以上のラジカルで置換されている)である]。

【0147】

S16) 主に除草剤として使用されるが作物植物に対する薬害軽減効果も有している活性成分、例えば、

(2,4-ジクロロフェノキシ)酢酸(2,4-D)、

(4-クロロフェノキシ)酢酸、

(R,S)-2-(4-クロロ-オトリルオキシ)プロピオン酸(メコプロップ)、 10

4-(2,4-ジクロロフェノキシ)酪酸(2,4-DB)、

(4-クロロ-オトリルオキシ)酢酸(MCPA)、

4-(4-クロロ-オトリルオキシ)酪酸、

4-(4-クロロフェノキシ)酪酸、

3,6-ジクロロ-2-メトキシ安息香酸(ジカンバ)、

3,6-ジクロロ-2-メトキシ安息香酸1-(エトキシカルボニル)エチル(ラクチジクロロ-エチル)。

【0148】

本発明による一般式(I)の化合物および/またはその塩、特に式(1-1)~(1-209)または(2-1)~(2-14)の化合物および/またはその塩と組み合わせる好ましい薬害軽減剤は、クロキントセット-メキシル、シプロスルファミド、フェンチロラゾール-エチルエステル、イソキサジフェン-エチル、メフェンビル-ジエチル、フェンクロリム、クミルロン、S4-1およびS4-5であり、特に好ましい薬害軽減剤は、クロキントセット-メキシル、シプロスルファミド、イソキサジフェン-エチルおよびメフェンビル-ジエチルである。 20

【0149】

生物学の実施例：

【0150】

以下の実施例および表において、以下の略語を使用する：

望ましくない植物/雑草：

ABUTH：イチビ(*Abutilon theophrasti*) 30

ALOMY：ノスズメノテッポウ(*Alopecurus myosuroides*)

AMARE：アオゲイトウ(*Amaranthus retroflexus*)

DIGSA：オニメヒシバ(*Digitaria sanguinalis*)

ECHCG：イヌビエ(*Echinochloa crus-galli*)

KCHSC：ホウキギ(*Kochia scoparia*)

LOLRI：ボウムギ(*Lolium rigidum*)

MATIN：イヌカミツレ(*Matricaria inodora*)

POAAN：スズメノカタビラ(*Poa annua*)

SETVI：エノコログサ(*Setaria viridis*) 40

STEME：コハコベ(*Stellaria media*)

VERPE：オオイヌノフグリ(*Veronica persica*)

VIOTR：サンシキスミレ(*Viola tricolor*)

【0151】

A. 1280 g/haでの出芽後の除草性効力

【0152】

単子葉および双子葉雑草植物の種子を、砂質ローム土壤中のプラスチックポットに入れ(各場合において、1ポット当たり1種の単子葉または双子葉雑草植物を二重に播種し)、土壌で覆い、制御された成長条件下で、温室で栽培した。播種から2~3週間後、試験植物を1葉段階で処理した。水和剤(WP)または乳剤(EC)の形態で製剤化された本 50

発明の化合物を、1ヘクタール当たり600リットルに相当する水施用量で0.5%の添加剤を添加して、水性懸濁液またはエマルジョンとして植物の緑色部分に施用した。試験植物を最適成長条件下で約3週間温室内に維持した後、調製物の活性を、未処理対照と比較して視覚的に評価した。

例えば、100%活性＝植物が枯死した、0%活性＝対照植物と同様。

【0153】

以下の表A1～A12は、上記で特定された試験手順によって得られた、様々な有害植物および1280g／haに対応する施用量における、表1による一般式（I）の選択された化合物の効果を示す。

【0154】

表A1：ABUTHに対する1280g／haでの出芽後の効力（%）

10

20

30

40

50

【表 5】

実施例番号	投与量 [g/ha]	ABUTH
1-1	1280	90
1-3	1280	90
1-23	1280	100
1-26	1280	100
1-27	1280	90
1-29	1280	90
1-31	1280	100
1-35	1280	100
1-37	1280	100
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-41	1280	90
1-42	1280	90
1-45	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	90
1-57	1280	90
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-70	1280	100
1-81	1280	90
1-87	1280	100
1-89	1280	90
1-90	1280	90
1-91	1280	100
1-92	1280	90
1-93	1280	90
1-95	1280	100
1-96	1280	100
1-97	1280	100
1-99	1280	90
1-100	1280	90
1-101	1280	90
1-103	1280	100
1-104	1280	100
1-105	1280	90
1-106	1280	90
1-110	1280	90
1-111	1280	90
1-112	1280	100

10

20

30

40

実施例番号	投与量 [g/ha]	ABUTH
1-127	1280	100
1-129	1280	100
1-130	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100
1-137	1280	90

10

【 0 1 5 5 】

表 A 2 : A L O M Y に対する 1 2 8 0 g / h a での出芽後の効力 (%)

【 表 6 】

実施例番号	投与量 [g/ha]	ALOMY
1-35	1280	90
1-40	1280	100
1-54	1280	90
1-55	1280	90
1-66	1280	90
1-130	1280	90
1-133	1280	90

20

【 0 1 5 6 】

表 A 3 : A M A R E に対する 1 2 8 0 g / h a での出芽後の効力 (%)

30

40

50

【表 7】

実施例番号	投与量 [g/ha]	AMARE	
1-1	1280	100	
1-3	1280	90	
1-23	1280	100	
1-26	1280	100	
1-27	1280	100	
1-29	1280	90	
1-31	1280	90	10
1-32	1280	90	
1-34	1280	90	
1-35	1280	100	
1-37	1280	100	
1-38	1280	100	
1-40	1280	100	
1-41	1280	90	
1-42	1280	100	
1-45	1280	100	
1-51	1280	100	
1-52	1280	100	
1-53	1280	100	20
1-54	1280	100	
1-55	1280	100	
1-56	1280	90	
1-57	1280	90	
1-58	1280	90	
1-59	1280	100	
1-65	1280	100	
1-66	1280	100	
1-68	1280	100	
1-69	1280	90	
1-70	1280	90	
1-71	1280	100	30
1-73	1280	90	
1-74	1280	90	
1-75	1280	90	
1-76	1280	90	
1-77	1280	90	
1-78	1280	90	
1-80	1280	100	
1-81	1280	90	
1-82	1280	100	
1-87	1280	100	
1-89	1280	100	
1-90	1280	100	40

実施例番号	投与量 [g/ha]	AMARE
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-94	1280	90
1-95	1280	100
1-96	1280	100
1-97	1280	100
1-98	1280	100
1-99	1280	100
1-100	1280	100
1-101	1280	100
1-103	1280	100
1-104	1280	100
1-105	1280	90
1-106	1280	100
1-110	1280	100
1-111	1280	100
1-112	1280	100
1-119	1280	100
1-123	1280	100
1-127	1280	100
1-129	1280	100
1-130	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100
1-137	1280	100

10

20

30

【 0 1 5 7 】
表 A 4 : D I G S A に対する 1 2 8 0 g ／ h a での出芽後の効力 (%)

40

50

【表 8】

実施例番号	投与量 [g/ha]	DIGSA
1-1	1280	90
1-23	1280	100
1-26	1280	90
1-27	1280	90
1-29	1280	90
1-35	1280	90
1-37	1280	90
1-38	1280	90
1-40	1280	90
1-45	1280	90
1-53	1280	90
1-54	1280	90
1-55	1280	100
1-56	1280	90
1-57	1280	90
1-58	1280	90
1-59	1280	100
1-66	1280	100
1-90	1280	90
1-91	1280	90
1-92	1280	90
1-99	1280	90
1-104	1280	100
1-112	1280	90
1-131	1280	90
1-133	1280	100

10

20

30

【 0 1 5 8 】

表 A 5：E C H C G に対する 1 2 8 0 g ／ h a での出芽後の効力（％）

40

50

【表 9】

実施例番号	投与量 [g/ha]	ECHCG
1-23	1280	100
1-26	1280	90
1-31	1280	100
1-35	1280	100
1-37	1280	100
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-42	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	90
1-57	1280	90
1-58	1280	90
1-59	1280	90
1-65	1280	90
1-66	1280	100
1-81	1280	90
1-87	1280	90
1-96	1280	90
1-99	1280	100
1-101	1280	90
1-104	1280	100
1-106	1280	90
1-112	1280	90
1-130	1280	90
1-131	1280	100
1-133	1280	100

10

20

30

【 0 1 5 9 】

表 A 6：K C H S C に対する 1 2 8 0 g ／ h a での出芽後の効力（％）

40

50

【表 1 0】

実施例番号	投与量 [g/ha]	KCHSC
1-1	1280	90
1-3	1280	90
1-23	1280	90
1-26	1280	100
1-27	1280	90
1-29	1280	90
1-35	1280	100
1-37	1280	100
1-38	1280	100
1-39	1280	90
1-40	1280	100
1-45	1280	100
1-51	1280	90
1-52	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	90
1-57	1280	90
1-58	1280	90
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-69	1280	90
1-71	1280	100
1-82	1280	90
1-87	1280	100
1-89	1280	100
1-90	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-95	1280	100
1-96	1280	90
1-97	1280	100
1-98	1280	90
1-99	1280	100
1-100	1280	100
1-103	1280	90

10

20

30

40

50

実施例番号	投与量 [g/ha]	KCHSC
1-104	1280	100
1-105	1280	90
1-106	1280	90
1-110	1280	90
1-111	1280	100
1-112	1280	100
1-119	1280	90
1-127	1280	100
1-129	1280	100
1-130	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100
1-137	1280	90

10

【 0 1 6 0 】

20

表 A 7 : L O L R I に対する 1 2 8 0 g / h a での出芽後の効力 (%)

【 表 1 1 】

実施例番号	投与量 [g/ha]	LOLRI
1-35	1280	90
1-40	1280	100
1-56	1280	90
1-66	1280	90
1-110	1280	90
1-133	1280	100

30

【 0 1 6 1 】

表 A 8 : M A T I N に対する 1 2 8 0 g / h a での出芽後の効力 (%)

【 表 1 2 】

実施例番号	投与量 [g/ha]	MATIN
1-55	1280	90
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-70	1280	90
1-131	1280	90

40

【 0 1 6 2 】

表 A 9 : P O A A N に対する 1 2 8 0 g / h a での出芽後の効力 (%)

50

【表 1 3】

実施例番号	投与量 [g/ha]	POAAN
1-1	1280	90
1-3	1280	100
1-23	1280	100
1-26	1280	90
1-27	1280	90
1-29	1280	90
1-31	1280	90
1-33	1280	90
1-35	1280	90
1-37	1280	100
1-38	1280	90
1-40	1280	90
1-41	1280	90
1-42	1280	90
1-45	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	90
1-57	1280	90
1-58	1280	90
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-74	1280	90
1-77	1280	90
1-87	1280	100
1-90	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-94	1280	90
1-95	1280	100
1-96	1280	90
1-97	1280	100
1-98	1280	90
1-99	1280	100

10

20

30

40

50

実施例番号	投与量 [g/ha]	POAAN
1-100	1280	100
1-101	1280	100
1-103	1280	100
1-104	1280	100
1-105	1280	90
1-106	1280	100
1-110	1280	100
1-111	1280	100
1-112	1280	100
1-123	1280	90
1-127	1280	100
1-129	1280	100
1-130	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100
1-137	1280	90

10

20

【 0 1 6 3 】

表 A 1 0 ： S E T V I に対する 1 2 8 0 g ／ h a での出芽後の効力（％）

30

40

50

【表 1 4】

実施例番号	投与量 [g/ha]	SETVI
1-23	1280	90
1-26	1280	90
1-27	1280	90
1-29	1280	90
1-31	1280	90
1-35	1280	90
1-38	1280	90
1-40	1280	90
1-45	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	90
1-57	1280	90
1-59	1280	90
1-65	1280	90
1-66	1280	100
1-74	1280	90
1-87	1280	90
1-91	1280	90
1-92	1280	100
1-95	1280	90
1-99	1280	90
1-100	1280	90
1-103	1280	90
1-104	1280	90
1-112	1280	90
1-127	1280	90
1-130	1280	90
1-131	1280	90
1-133	1280	100

10

20

30

【0 1 6 4】

表 A 1 1 : S T E M E に対する 1 2 8 0 g / h a での出芽後の効力 (%)

40

50

【表 1 5】

実施例番号	投与量 [g/ha]	STEME
1-1	1280	100
1-3	1280	90
1-8	1280	90
1-23	1280	90
1-26	1280	100
1-27	1280	90
1-31	1280	90
1-32	1280	90
1-33	1280	90
1-34	1280	90
1-35	1280	100
1-37	1280	90
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-42	1280	90
1-45	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	90
1-57	1280	90
1-58	1280	90
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-69	1280	90
1-70	1280	90
1-71	1280	90
1-77	1280	90
1-80	1280	90
1-87	1280	90
1-90	1280	90
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-95	1280	100
1-96	1280	90
1-97	1280	90
1-98	1280	90
1-99	1280	100
1-100	1280	90
1-101	1280	90
1-103	1280	100
1-104	1280	100
1-105	1280	90

10

20

30

40

50

実施例番号	投与量 [g/ha]	STEME
1-106	1280	100
1-110	1280	100
1-111	1280	100
1-112	1280	100
1-119	1280	100
1-123	1280	90
1-127	1280	100
1-129	1280	100
1-130	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100
1-137	1280	90

10

【 0 1 6 5 】

表 A 1 2 : V E R P E に対する 1 2 8 0 g ／ h a での出芽後の効力 (%)

20

30

40

50

【表 1 6】

実施例番号	投与量 [g/ha]	VERPE
1-1	1280	100
1-3	1280	90
1-8	1280	100
1-23	1280	100
1-26	1280	100
1-27	1280	90
1-29	1280	100
1-30	1280	90
1-31	1280	90
1-32	1280	90
1-33	1280	90
1-34	1280	100
1-35	1280	100
1-36	1280	90
1-37	1280	100
1-38	1280	100
1-39	1280	100
1-40	1280	100
1-41	1280	90
1-42	1280	90
1-45	1280	100
1-51	1280	100
1-52	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	90
1-57	1280	90
1-58	1280	90
1-59	1280	100
1-60	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-69	1280	100
1-70	1280	90
1-71	1280	90
1-73	1280	90
1-75	1280	90
1-76	1280	90
1-77	1280	90
1-80	1280	90
1-81	1280	90
1-82	1280	90
1-87	1280	100

10

20

30

40

50

実施例番号	投与量 [g/ha]	VERPE
1-89	1280	100
1-90	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-94	1280	100
1-95	1280	90
1-96	1280	100
1-97	1280	100
1-98	1280	100
1-99	1280	90
1-100	1280	100
1-101	1280	100
1-103	1280	100
1-104	1280	100
1-105	1280	90
1-106	1280	100
1-110	1280	100
1-111	1280	100
1-112	1280	100
1-119	1280	90
1-123	1280	100
1-127	1280	100
1-129	1280	90
1-130	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100
1-137	1280	90

10

20

30

【0166】

試験結果は、出芽後処理における一般式（I）の本発明の化合物が、選択された有害植物、例えば、イチビ（*Abutilon theophrasti*）、ノスズメノテッポウ（*Alopecurus myosuroides*）、アオゲイトウ（*Amaranthus retroflexus*）、オニメヒシバ（*Digitaria sanguinalis*）、イヌビエ（*Echinochloa crus-galli*）、ハウキギ（*Kochia scoparia*）、ボウムギ（*Lolium rigidum*）、イヌカミツレ（*Matricaria inodora*）、スズメノカタビラ（*Poa annua*）、エノコログサ（*Setaria viridis*）、コハコベ（*Stellaria media*）およびオオイヌノフグリ（*Veronica persica*）に対して、1ヘクタール当たり1280gの活性成分のそれぞれの施用量で、良好な除草性効力を示すことを示す。

40

【0167】

B. 80g／haでの出芽後の除草性効力

50

【0168】

単子葉および双子葉の雑草および作物植物の種子を、プラスチックまたは有機栽培ポット中の砂質ロームに入れ、土で覆い、制御された成長条件下で、温室で栽培した。播種から2～3週間後、試験植物を1葉段階で処理した。次いで、水和剤（WP）または乳剤（EC）の形態で製剤化された本発明の化合物を、0.5%の添加剤を加えた水性懸濁液またはエマルジョンとして、600 l / ha（換算）の水施用量で植物の緑色部分に噴霧した。試験植物を最適成長条件下で約3週間温室内に維持した後、調製物の活性を、未処理対照と比較して視覚的に評価した。例えば、100%活性＝植物が枯死した、0%活性＝対照植物と同様。

【0169】

以下の表B1～B10は、上記の試験手順によって得られた、様々な有害植物および80 g / haに対応する施用量における、表1による一般式（I）の選択された化合物の効果を示す。

【0170】

表B1：ABUTHに対する80 g / haでの出芽後の効力（%）

【表17】

実施例番号	投与量 [g/ha]	ABUTH
1-133	80	80
1-140	80	100

【0171】

表B2：ALOMYに対する80 g / haでの出芽後の効力（%）

【表18】

実施例番号	投与量 [g/ha]	ALOMY
1-140	80	80

【0172】

表B3：AMAREに対する80 g / haでの出芽後の効力（%）

10

20

30

40

50

【表 1 9】

実施例番号	投与量 [g/ha]	AMARE
1-14	80	95
1-15	80	90
1-16	80	100
1-17	80	90
1-18	80	90
1-20	80	90
1-21	80	90
1-40	80	90
1-51	80	100
1-52	80	80
1-54	80	100
1-56	80	100
1-59	80	100
1-67	80	100
1-131	80	100
1-133	80	100
1-135	80	100
1-140	80	100
1-142	80	80
1-150	80	80
1-151	80	80
1-152	80	90
1-153	80	90
1-154	80	90
1-156	80	80
1-157	80	80
1-159	80	80
1-160	80	100
1-186	80	90
1-187	80	90
1-193	80	90
1-194	80	98

10

20

30

40

【 0 1 7 3】

表 B 4：DIGSA に対する 80 g／ha での出芽後の効力（％）

【表 2 0】

実施例番号	投与量 [g/ha]	DIGSA
1-140	80	90

【 0 1 7 4】

50

表 B 5 : E C H C G に対する 8 0 g / h a での出芽後の効力 (%)

【表 2 1】

実施例番号	投与量 [g/ha]	ECHCG
1-140	80	90

【0 1 7 5】

表 B 6 : K C H S C に対する 8 0 g / h a での出芽後の効力 (%)

10

【表 2 2】

実施例番号	投与量 [g/ha]	KCHSC
1-40	80	90
1-56	80	80
1-59	80	90
1-133	80	100

20

【0 1 7 6】

表 B 7 : P O L C O に対する 8 0 g / h a での出芽後の効力 (%)

【表 2 3】

実施例番号	投与量 [g/ha]	POLCO
1-16	80	80
1-54	80	80
1-56	80	80
1-133	80	100
1-140	80	100

30

【0 1 7 7】

表 B 8 : S E T V I に対する 8 0 g / h a での出芽後の効力 (%)

【表 2 4】

実施例番号	投与量 [g/ha]	SETVI
1-140	80	80

40

【0 1 7 8】

表 B 9 : V E R P E に対する 8 0 g / h a での出芽後の効力 (%)

50

【表 2 5】

実施例番号	投与量 [g/ha]	VERPE
1-14	80	95
1-16	80	90
1-40	80	90
1-51	80	100
1-54	80	100
1-56	80	100
1-59	80	90
1-65	80	90
1-67	80	80
1-133	80	100
1-140	80	100
1-186	80	90
1-187	80	90
1-189	80	90
1-192	80	80
1-193	80	90

10

20

【0 1 7 9】

表 B 1 0 : V I O T R に対する 8 0 g / h a での出芽後の効力 (%)

【表 2 6】

実施例番号	投与量 [g/ha]	VIOTR
1-40	80	100
1-54	80	100
1-56	80	100
1-59	80	100
1-65	80	100
1-67	80	100
1-131	80	90
1-133	80	100

30

【0 1 8 0】

試験結果は、発芽後処理における一般式 (I) の本発明の化合物が、選択された有害植物、例えばイチビ (*Abutilon theophrasti*)、ノスズメノテッポウ (*Alopecurus myosuroides*)、アオゲイトウ (*Amaranthus retroflexus*)、オニメヒシバ (*Digitaria sanguinalis*)、イヌビエ (*Echinochloa crus-galli*)、ホウキギ (*Kochia scoparia*)、ソバカズラ (*Polygonum convolvulus*)、エノコログサ (*Setaria viridis*)、オオイヌノフグリ (*Veronica persica*) およびサンシキスミレ (*Viola tricolor*) に対して、それぞれ1ヘクタール当たり80gの活性物質の施用量で、良好な除草性効力を示すことを示す。

40

50

【0181】

C. 1280 g / ha での出芽前の除草剤の効力

【0182】

単子葉雑草植物および双子葉雑草植物の種子を、プラスチックポット中の砂質ローム土壌に入れ（各場合において、1ポット当たり1種の単子葉雑草植物または双子葉雑草植物を二重に播種し）、土壌で覆った。次いで、水和剤（WP）または乳剤（EC）の形態で製剤化された本発明の化合物を、0.5%の添加剤を添加した水性懸濁液またはエマルジョンとして、1ヘクタール当たり600リットルの水施用量（換算）で被覆土壌の表面に施用した。処理後、ポットを温室に置き、試験植物のための良好な成長条件下に維持した。約3週間後、調製物の効力を、未処理対照と比較して、パーセンテージとして視覚的にスコア化した。

10

例えば、100%活性＝植物が枯死した、0%活性＝対照植物と同様。

【0183】

以下の表C1～C12は、上記で特定された試験手順によって得られた、様々な有害植物および1280 g / haに対応する施用量における、表1による一般式（I）の選択された化合物の効果を示す。

【0184】

表C1：ABUTHに対する1280 g / haでの出芽前の効力（%）

20

30

40

50

【表 2 7】

実施例番号	投与量 [g/ha]	ABUTH
1-23	1280	100
1-26	1280	90
1-27	1280	100
1-29	1280	100
1-35	1280	90
1-39	1280	100
1-40	1280	100
1-42	1280	100
1-45	1280	100
1-51	1280	100
1-52	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-58	1280	90
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-69	1280	100
1-70	1280	90
1-75	1280	90
1-76	1280	90
1-77	1280	90
1-80	1280	90
1-82	1280	100
1-89	1280	100
1-90	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-95	1280	100
1-96	1280	100
1-98	1280	100
1-99	1280	90
1-100	1280	100
1-101	1280	90
1-103	1280	100
1-104	1280	100
1-110	1280	90
1-112	1280	90
1-129	1280	100

10

20

30

40

実施例番号	投与量 [g/ha]	ABUTH
1-130	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100
2-6	1280	100

50

【 0 1 8 5 】

表 C 2 : A L O M Y に対する 1 2 8 0 g / h a での出芽前の効力 (%)

【 表 2 8 】

実施例番号	投与量 [g/ha]	ALOMY
1-40	1280	100
1-53	1280	100
1-54	1280	90
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-59	1280	100
1-65	1280	90
1-66	1280	90
1-133	1280	100

10

【 0 1 8 6 】

表 C 3 : A M A R E に対する 1 2 8 0 g / h a での出芽前の効力 (%)

20

30

40

50

【表 2 9】

実施例番号	投与量 [g/ha]	AMARE
1-1	1280	100
1-8	1280	100
1-23	1280	100
1-26	1280	100
1-27	1280	100
1-29	1280	100
1-31	1280	90
1-32	1280	90
1-33	1280	100
1-34	1280	90
1-35	1280	100
1-37	1280	100
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-42	1280	100
1-45	1280	100
1-51	1280	100
1-52	1280	100
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-58	1280	90
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-70	1280	100
1-71	1280	100
1-73	1280	90
1-74	1280	100
1-75	1280	100
1-76	1280	100
1-77	1280	100
1-80	1280	100
1-82	1280	100
1-87	1280	100
1-89	1280	100
1-90	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-95	1280	100

10

20

30

40

50

実施例番号	投与量 [g/ha]	AMARE
1-96	1280	100
1-97	1280	100
1-98	1280	100
1-99	1280	100
1-100	1280	100
1-101	1280	100
1-103	1280	100
1-104	1280	100
1-105	1280	100
1-106	1280	90
1-110	1280	100
1-111	1280	100
1-112	1280	100
1-119	1280	90
1-123	1280	90
1-127	1280	100
1-129	1280	100
1-130	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100
1-137	1280	100
2-6	1280	90

【 0 1 8 7 】

表 C 4 : D I G S A に対する 1 2 8 0 g ／ h a での出芽前の効力 (%)

【表 3 0】

実施例番号	投与量 [g/ha]	DIGSA
1-1	1280	100
1-8	1280	100
1-23	1280	100
1-26	1280	100
1-27	1280	100
1-29	1280	100
1-31	1280	100
1-35	1280	90
1-37	1280	100
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-42	1280	100
1-45	1280	100
1-51	1280	100
1-52	1280	100
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-58	1280	100
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-70	1280	100
1-74	1280	100
1-77	1280	90
1-87	1280	100
1-89	1280	100
1-90	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-95	1280	90
1-96	1280	100
1-98	1280	100
1-99	1280	100
1-100	1280	100
1-101	1280	100
1-103	1280	90
1-104	1280	100
1-111	1280	90
1-112	1280	100
1-127	1280	90

実施例番号	投与量 [g/ha]	DIGSA
1-129	1280	90
1-131	1280	100
1-133	1280	100
2-6	1280	90

10

20

30

40

50

【 0 1 8 8 】

表 C 5 : E C H C G に対する 1 2 8 0 g / h a での出芽前の効力 (%)

【 表 3 1 】

実施例番号	投与量 [g/ha]	ECHCG
1-1	1280	90
1-8	1280	90
1-23	1280	100
1-26	1280	90
1-27	1280	90
1-29	1280	100
1-31	1280	100
1-35	1280	90
1-37	1280	90
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-42	1280	90
1-45	1280	100
1-51	1280	90
1-52	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-58	1280	90
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-70	1280	90
1-87	1280	90
1-90	1280	100
1-91	1280	90
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-95	1280	90
1-96	1280	90
1-98	1280	90
1-99	1280	100
1-100	1280	100
1-101	1280	100
1-103	1280	90
1-104	1280	100
1-105	1280	90
1-112	1280	100
1-129	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100

10

20

30

40

【 0 1 8 9 】

表 C 6 : K C H S C に対する 1 2 8 0 g / h a での出芽前の効力 (%)

50

【表 3 2】

実施例番号	投与量 [g/ha]	KCHSC
1-1	1280	90
1-23	1280	90
1-26	1280	100
1-27	1280	90
1-35	1280	100
1-40	1280	90
1-42	1280	100
1-45	1280	100
1-51	1280	100
1-52	1280	100
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-70	1280	100
1-74	1280	90
1-89	1280	100
1-90	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-95	1280	90
1-100	1280	100
1-112	1280	100
1-127	1280	90
1-129	1280	90
1-131	1280	100
1-133	1280	100

10

20

30

40

【0190】

表 C 7：LOLRI に対する 1280 g／h a での出芽前の効力（％）

【表 3 3】

実施例番号	投与量 [g/ha]	LOLRI
1-29	1280	100
1-40	1280	100
1-45	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	90
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-133	1280	90

【0 1 9 1】

表 C 8：M A T I N に対する 1 2 8 0 g ／ h a での出芽前の効力（％）

10

20

30

40

50

【表 3 4】

実施例番号	投与量 [g/ha]	MATIN
1-29	1280	90
1-35	1280	90
1-40	1280	90
1-42	1280	90
1-45	1280	90
1-51	1280	100
1-52	1280	100
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-58	1280	100
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-70	1280	100
1-75	1280	90
1-76	1280	90
1-89	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-100	1280	100
1-104	1280	100
1-129	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100

【0 1 9 2】

表 C 9：POAAN に対する 1 2 8 0 g / h a での出芽前の効力（%）

【表 3 5】

実施例番号	投与量 [g/ha]	POAAN
1-1	1280	90
1-23	1280	90
1-26	1280	100
1-27	1280	90
1-29	1280	100
1-31	1280	100
1-33	1280	100
1-35	1280	90
1-37	1280	90
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-41	1280	90
1-42	1280	90
1-45	1280	90
1-51	1280	90
1-52	1280	100
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-58	1280	100
1-59	1280	100
1-60	1280	90
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-70	1280	90
1-72	1280	90
1-74	1280	100
1-77	1280	90
1-78	1280	90
1-79	1280	90
1-80	1280	90
1-81	1280	100
1-82	1280	90
1-89	1280	100
1-90	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-95	1280	90
1-98	1280	90
1-99	1280	100

10

20

30

40

50

実施例番号	投与量 [g/ha]	POAAN
1-100	1280	100
1-101	1280	100
1-103	1280	90
1-104	1280	100
1-105	1280	100
1-110	1280	90
1-112	1280	90
1-119	1280	90
1-127	1280	90
1-129	1280	90
1-130	1280	90
1-131	1280	90
1-133	1280	100
1-137	1280	90

【 0 1 9 3 】

表 C 1 0 : S E T V I に対する 1 2 8 0 g ／ h a での出芽前の効力 (%)

10

20

30

40

50

【表 3 6】

実施例番号	投与量 [g/ha]	SETVI
1-1	1280	90
1-8	1280	90
1-23	1280	100
1-26	1280	90
1-27	1280	100
1-29	1280	100
1-31	1280	100
1-33	1280	100
1-35	1280	90
1-37	1280	100
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-42	1280	100
1-45	1280	100
1-51	1280	100
1-52	1280	100
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-58	1280	100
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-70	1280	100
1-74	1280	100
1-87	1280	100
1-89	1280	90
1-90	1280	90
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-96	1280	90
1-98	1280	90
1-99	1280	100
1-100	1280	100
1-101	1280	100
1-103	1280	100
1-104	1280	100
1-112	1280	90
1-127	1280	100
1-129	1280	90
1-130	1280	90

10

20

30

40

実施例番号	投与量 [g/ha]	SETVI
1-131	1280	100
1-133	1280	100
1-137	1280	100

表 C 1 1 : S T E M E に対する 1 2 8 0 g / h a での出芽前の効力 (%)
【表 3 7 】

実施例番号	投与量 [g/ha]	STEME
1-8	1280	90
1-23	1280	100
1-29	1280	90
1-33	1280	90
1-34	1280	90
1-35	1280	100
1-37	1280	90
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-42	1280	100
1-45	1280	100
1-51	1280	100
1-52	1280	100
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-58	1280	100
1-59	1280	100
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-70	1280	100
1-71	1280	90
1-76	1280	90
1-77	1280	90
1-80	1280	100
1-82	1280	100
1-89	1280	90
1-90	1280	90
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-95	1280	100
1-98	1280	90
1-99	1280	100
1-100	1280	100
1-101	1280	100
1-103	1280	100
1-104	1280	100
1-105	1280	90
1-110	1280	100

10

20

30

40

50

実施例番号	投与量 [g/ha]	STEME
1-112	1280	90
1-127	1280	90
1-129	1280	100
1-131	1280	100
1-133	1280	100
1-137	1280	100
2-6	1280	100

10

【 0 1 9 5 】
表 C 1 2 : V E R P E に対する 1 2 8 0 g ／ h a での出芽前の効力 (%)

20

30

40

50

【表 3 8】

実施例番号	投与量 [g/ha]	VERPE
1-23	1280	100
1-27	1280	100
1-29	1280	100
1-33	1280	100
1-35	1280	100
1-38	1280	100
1-40	1280	100
1-42	1280	90
1-45	1280	100
1-51	1280	100
1-52	1280	90
1-53	1280	100
1-54	1280	100
1-55	1280	100
1-56	1280	100
1-57	1280	100
1-58	1280	90
1-59	1280	100
1-60	1280	90
1-65	1280	100
1-66	1280	100
1-70	1280	90
1-76	1280	90
1-89	1280	100
1-90	1280	100
1-91	1280	100
1-92	1280	100
1-93	1280	100
1-95	1280	100
1-98	1280	90
1-100	1280	100
1-103	1280	90
1-104	1280	100
1-105	1280	100
1-112	1280	100
1-127	1280	90
1-129	1280	90
1-130	1280	90
1-131	1280	100
1-133	1280	100

10

20

30

40

【0196】

試験結果は、出芽前処理における一般式（I）の本発明の化合物が、選択された有害植物、例えば、イチビ（*Abutilon theophrasti*）、ノスズメノテッポウ（*Alopecurus myosuroides*）、アオゲイトウ（*Amaranthus retroflexus*）、オニメヒシバ（*Digitaria sanguinalis*）、イヌビエ（*Echinochloa crus-galli*）、ホウキギ（*Kochia scoparia*）、ボウムギ（*Lolium rigidum*）、イヌカミツレ（*Matricaria inodora*）、スズメノカタビラ（*Poa annua*）、エノコログサ（*Setaria viridis*）、コハコベ（*Stell*

50

a r i a m e d i a) およびオオイヌノフグリ (V e r o n i c a p e r s i c a) に対して、1ヘクタール当たり1280gの活性成分のそれぞれの施用量で、良好な除草性効力を示すことを示す。

【0197】

D. 80g / haでの出芽前の除草剤の効力

【0198】

単子葉および双子葉の雑草植物および作物植物の種子をプラスチックまたは有機栽培ポットに入れ、土壌で覆った。次いで、水和剤 (W P) または乳剤 (E C) の形態で製剤化された本発明の化合物を、0.5%添加剤を添加した水性懸濁液またはエマルジョンとして、600l / haに相当する水施用量で被覆土壌の表面に施用した。処理後、ポットを温室に置き、試験植物のための良好な成長条件下に維持した。約3週間後、調製物の効力を、未処理対照と比較して、パーセンテージとして視覚的にスコア化した。例えば、100%活性=植物が枯死した、0%活性=対照植物と同様。

【0199】

以下の表D1～D12は、上記で特定された試験手順によって得られた、様々な有害植物および80g / haに対応する施用量における、表1による一般式 (I) の選択された化合物の効果を示す。

【0200】

表D1: A B U T Hに対する80g / haでの出芽前の効力 (%)

【表39】

実施例番号	投与量 [g/ha]	ABUTH
1-52	80	90
1-54	80	100
1-56	80	100
1-59	80	100
1-65	80	90
1-67	80	100
1-133	80	100
1-135	80	95
1-156	80	90
1-152	80	80
1-140	80	100

【0201】

表D2: A L O M Yに対する80g / haでの出芽前の効力 (%)

【表40】

実施例番号	投与量 [g/ha]	ALOMY
1-54	80	80
1-59	80	80
1-140	80	90

【0202】

表D3: A M A R Eに対する80g / haでの出芽前の効力 (%)

10

20

30

40

50

【表 4 1】

実施例番号	投与量 [g/ha]	AMARE
1-14	80	90
1-16	80	100
1-17	80	80
1-21	80	90
1-45	80	100
1-50	80	90
1-51	80	90
1-52	80	100
1-54	80	100
1-56	80	100
1-59	80	100
1-65	80	100
1-67	80	90
1-131	80	100
1-133	80	100
1-135	80	100
1-140	80	100
1-151	80	80
1-152	80	100
1-153	80	100
1-154	80	100
1-156	80	100
1-157	80	100
1-159	80	90
1-160	80	100
1-162	80	90
1-166	80	95
1-187	80	100
1-189	80	80
1-194	80	100

10

20

30

【0203】

表 D 4：DIGSA に対する 80 g／ha での出芽前の効力（％）

40

【表 4 2】

実施例番号	投与量 [g/ha]	DIGSA
1-54	80	100
1-56	80	100
1-59	80	100
1-65	80	90
1-133	80	100
1-140	80	100
1-152	80	90
1-156	80	90
1-157	80	80
1-165	80	80
1-166	80	100
1-194	80	90

10

【 0 2 0 4】

表 D 5：ECHCG に対する 80 g / h a での出芽前の効力（%）

20

【表 4 3】

実施例番号	投与量 [g/ha]	ECHCG
1-54	80	100
1-56	80	80
1-59	80	100
1-133	80	80
1-140	80	100

30

【 0 2 0 5】

表 D 6：KCHSC に対する 80 g / h a での出芽前の効力（%）

【表 4 4】

実施例番号	投与量 [g/ha]	KCHSC
1-50	80	90
1-54	80	100
1-56	80	90
1-59	80	100
1-65	80	100
1-133	80	100

40

【 0 2 0 6】

表 D 7：LOLRI に対する 80 g / h a での出芽前の効力（%）

50

【表 4 5】

実施例番号	投与量 [g/ha]	LOLRI
1-140	80	90

【0 2 0 7】

表 D 8 : M A T I N に対する 8 0 g / h a での出芽前の効力 (%)

【表 4 6】

実施例番号	投与量 [g/ha]	MATIN
1-54	80	90
1-56	80	100
1-59	80	100
1-65	80	100
1-133	80	80
1-140	80	80
1-156	80	80

10

20

【0 2 0 8】

表 D 9 : P O L C O に対する 8 0 g / h a での出芽前の効力 (%)

【表 4 7】

実施例番号	投与量 [g/ha]	POLCO
1-54	80	80
1-56	80	90
1-59	80	90
1-131	80	80
1-133	80	80
1-135	80	90
1-140	80	90
1-152	80	90
1-154	80	80
1-156	80	80
1-162	80	80
1-165	80	80
1-166	80	90
1-194	80	90

30

40

【0 2 0 9】

表 D 1 0 : S E T V I に対する 8 0 g / h a での出芽前の効力 (%)

50

【表 4 8】

実施例番号	投与量 [g/ha]	SETVI
1-54	80	100
1-56	80	100
1-59	80	100
1-65	80	90
1-133	80	100
1-140	80	100
1-152	80	80
1-166	80	80
1-194	80	100

10

【0 2 1 0】

表 D 1 1 : V E R P E に対する 8 0 g / h a での出芽前の効力 (%)

【表 4 9】

実施例番号	投与量 [g/ha]	VERPE
1-16	80	90
1-51	80	80
1-54	80	90
1-56	80	90
1-59	80	90
1-65	80	100
1-133	80	90
1-135	80	95
1-140	80	100
1-194	80	90

20

30

【0 2 1 1】

表 D 1 2 : V I O T R に対する 8 0 g / h a での出芽前の効力 (%)

【表 5 0】

実施例番号	投与量 [g/ha]	VIOTR
1-40	80	100
1-54	80	100
1-56	80	100
1-59	80	100
1-65	80	100
1-131	80	90
1-133	80	80

40

【0 2 1 2】

試験結果は、出芽前処理における一般式 (I) の本発明の化合物が、選択された有害植

50

物、例えば、イチビ (*Abutilon theophrasti*)、ノスズメノテッポウ (*Alopecurus myosuroides*)、アオゲイトウ (*Amaranthus retroflexus*)、オニメヒシバ (*Digitaria sanguinalis*)、イヌビエ (*Echinochloa crus-galli*)、ハウキギ (*Kochia scoparia*)、ボウムギ (*Lolium rigidum*)、イヌカミツレ (*Matricaria inodora*)、ソバカズラ (*Polygonum convolvulus*)、エノコログサ (*Setaria viridis*)、オオイヌノフグリ (*Veronica persica*) およびサンシキスミレ (*Viola tricolor*) に対して、1ヘクタール当たり80gの活性成分のそれぞれの施用量で、良好な除草性効力を示すことを示す。

10

20

30

40

50

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International application No. PCT/EP2023/057451
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER <i>C07D 239/30</i> (2006.01)i; <i>C07D 401/10</i> (2006.01)i; <i>C07D 401/12</i> (2006.01)i; <i>C07D 403/10</i> (2006.01)i; <i>C07D 403/12</i> (2006.01)i; <i>C07D 413/10</i> (2006.01)i; <i>A01N 43/80</i> (2006.01)i; <i>A01N 43/40</i> (2006.01)i According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D; A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WU GAORONG ET AL. "Metal-free directed C-H borylation of 2-(N-methylanilino)-5-fluoropyridines and 2-benzyl-5-fluoropyridines" <i>CHINESE CHEMICAL LETTERS, ELSEVIER, AMSTERDAM, NL</i> , Vol. 33, No. 4, 30 September 2021 (2021-09-30), pages 2005-2008, [retrieved on 2021-09-30] DOI: 10.1016/J.CCLET.2021.09.081 ISSN: 1001-8417, XP087028372 abstract; scheme 6, compound 8	1-4
A	WO 2020193474 A1 (BAYER AG [DE]) 01 October 2020 (2020-10-01) cited in the application page 1, line 8 - page 1, line 9; claims; examples	1-15
A	WO 202002089 A1 (BAYER AG [DE]) 02 January 2020 (2020-01-02) cited in the application page 1, line 10 - page 1, line 11; claims; examples	1-15
A	WO 2022002838 A1 (BAYER AG [DE]) 06 January 2022 (2022-01-06) cited in the application page 1, line 10 - page 1, line 11; claims; examples	1-15
☒ 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 25 May 2023		Date of mailing of the international search report 05 June 2023
Name and mailing address of the ISA/EP European Patent Office p.b. 5818, Patentlaan 2, 2280 HV Rijswijk Netherlands Telephone No. (+31-70)340-2040 Facsimile No. (+31-70)340-3016		Authorized officer Schmid, Arnold Telephone No.

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (January 2015)

10

20

30

40

50

International application No.

PCT/EP2023/057451

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2021204706 A1 (SYNGENTA CROP PROTECTION AG [CH]) 14 October 2021 (2021-10-14) cited in the application page 1, line 4 - page 1, line 7; claims; examples	1-15

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.

PCT/EP2023/057451

Patent document cited in search report			Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)			Publication date (day/month/year)
WO	2020193474	A1	01 October 2020	AR	118486	A1	06 October 2021
				CN	113677665	A	19 November 2021
				EP	3947350	A1	09 February 2022
				JP	2022525976	A	20 May 2022
				US	2022169618	A1	02 June 2022
				WO	2020193474	A1	01 October 2020
WO	2020002089	A1	02 January 2020	AR	115629	A1	10 February 2021
				AU	2019294743	A1	14 January 2021
				BR	112020025919	A2	16 March 2021
				CA	3105217	A1	02 January 2020
				CN	112469712	A	09 March 2021
				EA	202190111	A1	23 April 2021
				EP	3810589	A1	28 April 2021
				JP	2021528448	A	21 October 2021
				US	2021276974	A1	09 September 2021
				WO	2020002089	A1	02 January 2020
WO	2022002838	A1	06 January 2022	AR	122817	A1	05 October 2022
				AU	2021298813	A1	02 February 2023
				BR	112022026299	A2	17 January 2023
				CA	3188782	A1	06 January 2022
				CN	115996919	A	21 April 2023
				EP	4172153	A1	03 May 2023
				WO	2022002838	A1	06 January 2022
WO	2021204706	A1	14 October 2021	AR	121732	A1	06 July 2022
				BR	112022020055	A2	22 November 2022
				CN	115335364	A	11 November 2022
				EP	4132913	A1	15 February 2023
				UY	39154	A	30 November 2021
				WO	2021204706	A1	14 October 2021

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (January 2015)

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2023/057451

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES		
INV.	C07D239/30 C07D401/10 C07D413/10	C07D401/12 C07D403/10 C07D403/12
ADD.	A01N43/80 A01N43/40	
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE		
Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) C07D A01N		
Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, CHEM ABS Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WU GAORONG ET AL: "Metal-free directed C-H borylation of 2-(N-methylanilino)-5-fluoropyridines and 2-benzyl-5-fluoropyridines", CHINESE CHEMICAL LETTERS, ELSEVIER, AMSTERDAM, NL, Bd. 33, Nr. 4, 30. September 2021 (2021-09-30), Seiten 2005-2008, XP087028372, ISSN: 1001-8417, DOI: 10.1016/J.CCLET.2021.09.081 [gefunden am 2021-09-30] Abstract; Schema 6, Verbindung 8 ----- -/-	1-4
☒ Weitere Veröffentlichungen sind die Fortsetzung von Feld C zu entnehmen ☒ Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist "E" frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist "T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung;; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung;; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist "&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche 25. Mai 2023		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts 05/06/2023
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter Schmid, Arnold

Formblatt PCTISA/210 (Blatt 2) (April 2005)

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2023/057451

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 2020/193474 A1 (BAYER AG [DE]) 1. Oktober 2020 (2020-10-01) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Zeile 8 - Seite 1, Zeile 9; Ansprüche; Beispiele -----	1-15
A	WO 2020/002089 A1 (BAYER AG [DE]) 2. Januar 2020 (2020-01-02) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Zeile 10 - Seite 1, Zeile 11; Ansprüche; Beispiele -----	1-15
A	WO 2022/002838 A1 (BAYER AG [DE]) 6. Januar 2022 (2022-01-06) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Zeile 10 - Seite 1, Zeile 11; Ansprüche; Beispiele -----	1-15
A	WO 2021/204706 A1 (SYNGENTA CROP PROTECTION AG [CH]) 14. Oktober 2021 (2021-10-14) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Zeile 4 - Seite 1, Zeile 7; Ansprüche; Beispiele -----	1-15

1

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

Seite 2 von 2

10

20

30

40

50

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2023/057451

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2020193474 A1	01-10-2020	AR 118486 A1	06-10-2021
		CN 113677665 A	19-11-2021
		EP 3947350 A1	09-02-2022
		JP 2022525976 A	20-05-2022
		US 2022169618 A1	02-06-2022
		WO 2020193474 A1	01-10-2020
WO 2020002089 A1	02-01-2020	AR 115629 A1	10-02-2021
		AU 2019294743 A1	14-01-2021
		BR 112020025919 A2	16-03-2021
		CA 3105217 A1	02-01-2020
		CN 112469712 A	09-03-2021
		EA 202190111 A1	23-04-2021
		EP 3810589 A1	28-04-2021
		JP 2021528448 A	21-10-2021
		US 2021276974 A1	09-09-2021
		WO 2020002089 A1	02-01-2020
WO 2022002838 A1	06-01-2022	AR 122817 A1	05-10-2022
		AU 2021298813 A1	02-02-2023
		BR 112022026299 A2	17-01-2023
		CA 3188782 A1	06-01-2022
		CN 115996919 A	21-04-2023
		EP 4172153 A1	03-05-2023
		WO 2022002838 A1	06-01-2022
WO 2021204706 A1	14-10-2021	AR 121732 A1	06-07-2022
		BR 112022020055 A2	22-11-2022
		CN 115335364 A	11-11-2022
		EP 4132913 A1	15-02-2023
		UY 39154 A	30-11-2021
		WO 2021204706 A1	14-10-2021

フロントページの続き

(51)国際特許分類

F I

テーマコード (参考)

C O 7 D	401/04	(2006.01)	C O 7 D	401/04	
C O 7 D	413/04	(2006.01)	C O 7 D	413/04	
C O 7 D	413/14	(2006.01)	C O 7 D	413/14	
C O 7 D	403/14	(2006.01)	C O 7 D	403/14	
A O 1 P	13/00	(2006.01)	A O 1 P	13/00	
A O 1 N	43/54	(2006.01)	A O 1 N	43/54	B
A O 1 N	43/56	(2006.01)	A O 1 N	43/54	F
A O 1 N	43/40	(2006.01)	A O 1 N	43/56	B
			A O 1 N	43/40	1 0 1 F
			A O 1 N	43/40	1 0 1 A

,MC,ME,MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CV,CZ,DE,DJ,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IQ,IR,IS,IT,JM,JO,JP,KE,KG,KH,KN,KP,KR,KW,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,MG,MK,MN,MU,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,WS,ZA,ZM,ZW

(74)代理人 100196483

弁理士 川寄 洋祐

(74)代理人 100160255

弁理士 市川 祐輔

(74)代理人 100216839

弁理士 大石 敏幸

(74)代理人 100228980

弁理士 副島 由加里

(74)代理人 100151448

弁理士 青木 孝博

(74)代理人 100146318

弁理士 岩瀬 吉和

(74)代理人 100127812

弁理士 城山 康文

(72)発明者 ブラウン,ラルフ

ドイツ連邦共和国、5 1 3 7 3・レーフェルクーゼン、カイザー・ヴイルヘルム・アレー・1、バイエル・アクチエンゲゼルシャフト気付

(72)発明者 ハイネマン,イネス

ドイツ連邦共和国、5 1 3 7 3・レーフェルクーゼン、カイザー・ヴイルヘルム・アレー・1、バイエル・アクチエンゲゼルシャフト気付

(72)発明者 パドマナバン,モハン

ドイツ連邦共和国、5 1 3 7 3・レーフェルクーゼン、カイザー・ヴイルヘルム・アレー・1、バイエル・アクチエンゲゼルシャフト気付

(72)発明者 バダート,ミヒャエル・ペーター

ドイツ連邦共和国、5 1 3 7 3・レーフェルクーゼン、カイザー・ヴイルヘルム・アレー・1、バイエル・アクチエンゲゼルシャフト気付

(72)発明者 ボーレンバッハー・ヴァール,ビルギット

ドイツ連邦共和国、5 1 3 7 3・レーフェルクーゼン、カイザー・ヴイルヘルム・アレー・1、バイエル・アクチエンゲゼルシャフト気付

(72)発明者 シュムツラー,ディルク

ドイツ連邦共和国、5 1 3 7 3・レーフェルクーゼン、カイザー・ヴイルヘルム・アレー・1、バイエル・アクチエンゲゼルシャフト気付

(72)発明者 ライングルーバー,アンナ・マリア

ドイツ連邦共和国、5 1 3 7 3・レーフェルクーゼン、カイザー・ヴィルヘルム・アレー・1、バ
イエル・アクチエンゲゼルシャフト気付

F ターム (参考) 4H011 AA01 AB01 AC01 AC04 BA03 BA06 BB09