(19)日本国特許庁(JP)　(12)公表特許公報(A)　(11)公表番号
特表2025-520130
(P2025-520130A)
(43)公表日　令和7年7月1日(2025.7.1)

(51)国際特許分類		FI		テーマコード（参考）
C07D 213/79	*(2006.01)*	C07D	213/79	CSP　4H011
C07D 401/06	*(2006.01)*	C07D	401/06	
C07D 417/06	*(2006.01)*	C07D	417/06	
C07D 409/06	*(2006.01)*	C07D	409/06	
C07D 413/06	*(2006.01)*	C07D	413/06	

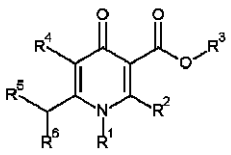
審査請求　未請求　予備審査請求　未請求　（全109頁）　最終頁に続く

(21)出願番号　特願2024-570726(P2024-570726)
(86)(22)出願日　令和5年5月26日(2023.5.26)
(85)翻訳文提出日　令和6年11月29日(2024.11.29)
(86)国際出願番号　PCT/EP2023/064174
(87)国際公開番号　WO2023/232674
(87)国際公開日　令和5年12月7日(2023.12.7)
(31)優先権主張番号　22176867.4
(32)優先日　令和4年6月1日(2022.6.1)
(33)優先権主張国・地域又は機関
欧州特許庁(EP)
(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
最終頁に続く

(71)出願人　520222106
シンジェンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト
スイス ４０５８ バーゼル ローゼンタールシュトラーセ ６７
(74)代理人　100103610
弁理士　▲吉▼田 和彦
(74)代理人　100109070
弁理士　須田 洋之
(74)代理人　100119013
弁理士　山崎 一夫
(74)代理人　100111796
弁理士　服部 博信
(74)代理人　100123766
弁理士　松田 七重
最終頁に続く

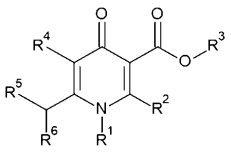
(54)【発明の名称】　除草性誘導体

(57)【要約】
置換基は請求項１に定義されているとおりである、式（Ｉ）の化合物。本発明はさらに、式（Ｉ）の化合物を含む除草組成物、及び、特に有用な植物の作物における、雑草を防除するための式（Ｉ）の化合物の使用に関する。



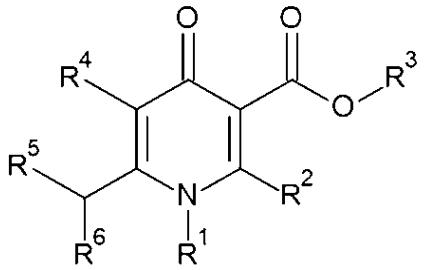
(I)

【化１】



(I)

【特許請求の範囲】
【請求項１】
式（Ｉ）：
【化１】



(I)

（式中、
Ｒ[1]は、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシ、Ｃ[2]～Ｃ[6]アルケニル、Ｃ[2]～Ｃ[6]アルキニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシＣ[1]～Ｃ[6]アルキル又はＣ[3]～Ｃ[6]シクロアルキルであり；
Ｒ[2]はフェニル又はヘテロアリールであり、ここで、前記ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２、３又は４個のヘテロ原子を含む５員又は６員芳香族環であり、並びに、ここで、各フェニル及びヘテロアリール部分は、Ｒ[7]により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３又は４つの基で任意に置換されていてもよく；
Ｒ[3]は水素又はＣ[1]～Ｃ[6]アルキルであり；
Ｒ[4]は、水素、ハロゲン、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキル又はＣ[1]～Ｃ[6]ハロアルキルであり；
Ｒ[5]はフェニル又はヘテロアリールであり、ここで、前記ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２、３又は４個のヘテロ原子を含む５員又は６員芳香族環であり、並びに、ここで、各フェニル及びヘテロアリール部分は、Ｒ[9]により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３又は４つの基で任意に置換されていてもよく、並びに、ここで、Ｒ[5]が５員ヘテロアリールである場合、前記ヘテロアリール部分は、炭素原子を介して分子の残部に結合しており；
Ｒ[6]は、水素、ハロゲン、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシ又はＣ[1]～Ｃ[6]アルコキシＣ[1]～Ｃ[6]アルキルであり；
Ｒ[7]は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシ、Ｃ[1]～Ｃ[6]ハロアルキル、Ｃ[1]～Ｃ[6]ハロアルコキシ、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシＣ[1]～Ｃ[6]アルキル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルスルファニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルスルフィニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルスルホニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルスルホンアミド、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルカルボニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシカルボニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルアミノカルボニル、Ｃ[3]～Ｃ[6]シクロアルキル、Ｃ[3]～Ｃ[6]シクロアルキルアミノカルボニル又はＮ，Ｎ－ジ（Ｃ[1]～Ｃ[4]アルキル）アミノカルボニルであり；
Ｒ[9]は、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、ハロゲン、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシ、Ｃ[1]～Ｃ[6]ハロアルキル、Ｃ[1]～Ｃ[6]ハロアルコキシ、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシＣ[1]～Ｃ[6]アルキル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルスルファニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルスルフィニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルスルホニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルスルホンアミド、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルカルボニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルアミノカルボニル、Ｃ[3]～Ｃ[6]シクロアルキル、Ｃ[3]～Ｃ[6]シクロアルキルアミノカルボニル、Ｎ，Ｎ－ジ（Ｃ[1]～Ｃ[4]アルキル）アミノカルボニル若しくはベンジルオキシであり；又は
いずれか２つの隣接するＲ[9]基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、Ｃ[3]～Ｃ[6]シクロアルキル環若しくはフェニル環を形成し得、ここで、前記Ｃ[3]～Ｃ[6]シクロアルキル及びフェニル部分は、Ｒ[10]により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３若しくは４つの基で任意に置換されていてもよく；又は
いずれか２つの隣接するＲ[9]基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若

しくは６員ヘテロアリール環を形成し得、ここで、前記ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２、３若しくは４個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員芳香族環であり、並びに、ここで、前記ヘテロアリール部分は、R^{10}により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３若しくは４つの基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれか２つの隣接するR^{9}基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロシクリル環を形成し得、ここで、前記ヘテロシクリル部分は、Ｏ及びＮから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員であり、並びに、ここで、前記ヘテロシクリル環は、R^{10}により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３若しくは４つの基で任意に置換されていてもよく；

R^{10}は、ハロゲン、C_1～C_3アルキル又はC_1～C_3アルコキシである）

の化合物、又はその塩若しくはＮ－オキシド。

【請求項２】

R^{1}は、C_1～C_4アルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_2～C_3アルケニル、C_2～C_3アルキニル、C_1～C_3アルコキシC_1～C_3アルキル又はC_3～C_4シクロアルキルである、請求項１に記載の化合物。

【請求項３】

R^{2}は、R^{7}により表される、同一であっても異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよいフェニルである、請求項１又は請求項２に記載の化合物。

【請求項４】

R^{4}は水素である、請求項１～３のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項５】

R^{5}はフェニル又はヘテロアリールであり、ここで、前記ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２又は３個のヘテロ原子を含む５員又は６員芳香族環であり、並びに、ここで、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^{9}により表される、同一であっても異なっていてもよい１、２又は３つの基で任意に置換されていてもよく、並びに、ここで、R^{5}が５員ヘテロアリールである場合、前記ヘテロアリール部分は炭素原子を介して分子の残部に結合している、請求項１～４のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項６】

R^{5}はフェニル又はヘテロアリールであり、ここで、前記ヘテロアリール部分は、Ｎ及びＳから個々に選択される１又は２個のヘテロ原子を含む５員又は６員芳香族環であり、並びに、ここで、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^{9}により表される、同一であっても異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよく、並びに、ここで、R^{5}が５員ヘテロアリールである場合、前記ヘテロアリール部分は炭素原子を介して分子の残部に結合している、請求項１～５のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項７】

R^{6}は水素である、請求項１～６のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項８】

R^{7}は、シアノ、ハロゲン又はC_1～C_3アルコキシである、請求項１～７のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項９】

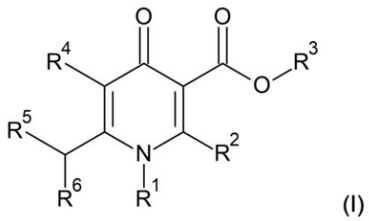
R^{9}は、シアノ、ヒドロキシ、クロロ、フルオロ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_1～C_2ハロアルキル、トリフルオロメトキシ、メトキシメチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、アセチル、メトキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル又はシクロプロピルである、請求項１～７のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１０】

R^{2}は、３－クロロ－４－シアノフェニル、３，４－ジクロロフェニル、３－クロロ－４－イソプロポキシフェニル又は３，４－ジフルオロフェニルである、請求項１～９のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１１】

請求項１～１０のいずれか一項に記載の化合物及び農学的に許容可能な配合補助剤を含む除草組成物。
【請求項１２】
少なくとも１種の追加の殺有害生物剤をさらに含む、請求項１１に記載の除草組成物。
【請求項１３】
前記追加の殺有害生物剤は、除草剤又は除草剤毒性緩和剤である、請求項１２に記載の除草組成物。
【請求項１４】
生息地における雑草の防除方法であって、防除量の請求項１１～１３のいずれか一項に記載の組成物を雑草の前記生息地に適用するステップを含む方法。
【請求項１５】
請求項１～１０のいずれか一項に記載の式（Ｉ）の化合物の除草剤としての使用。
【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
本発明は、例えば除草性活性を有する有効成分としての除草性ピリドン誘導体に関する。本発明はまた、少なくとも１種のピリドン誘導体を含む農薬組成物、これら化合物の調製プロセス、及び、特に有用な植物の作物における、農業又は園芸における雑草の防除におけるピリドン誘導体又は組成物の使用に関する。
【背景技術】
【０００２】
欧州特許第０２３９３９１号明細書、欧州特許第０１２７３１３号明細書、欧州特許第００４００８２号明細書、及び英国特許第２１８２９３１号明細書には、除草剤としてのピリドン誘導体が記載されている。
【発明の概要】
【課題を解決するための手段】
【０００３】
本発明によれば、式（Ｉ）：
【化１】



(I)

（式中、
R^1は、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキル又はC_3～C_6シクロアルキルであり；
R^2はフェニル又はヘテロアリールであり、ここで、ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２、３又は４個のヘテロ原子を含む５員又は６員芳香族環であり、並びに、ここで、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^7により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３又は４つの基で任意に置換されていてもよく；
R^3は水素又はC_1～C_6アルキルであり；
R^4は、水素、ハロゲン、C_1～C_6アルキル又はC_1～C_6ハロアルキルであり；
R^5はフェニル又はヘテロアリールであり、ここで、ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２、３又は４個のヘテロ原子を含む５員又は６員芳香族環であり、並びに、ここで、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^9により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３又は４つの基で任意に置換されていてもよく

、並びに、ここで、R^5が５員ヘテロアリールである場合、ヘテロアリール部分は、炭素原子を介して分子の残部に結合しており；
　R^6は、水素、ハロゲン、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ又はC_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキルであり；
　R^7は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルキルスルファニル、C_1～C_6アルキルスルフィニル、C_1～C_6アルキルスルホニル、C_1～C_6アルキルスルホンアミド、C_1～C_6アルキルカルボニル、C_1～C_6アルコキシカルボニル、C_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル又はＮ，Ｎ－ジ（C_1～C_4アルキル）アミノカルボニルであり；
　R^9は、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、ハロゲン、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルキルスルファニル、C_1～C_6アルキルスルフィニル、C_1～C_6アルキルスルホニル、C_1～C_6アルキルスルホンアミド、C_1～C_6アルキルカルボニル、C_1～C_6アルコキシカルボニル、C_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル、Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_4アルキル）アミノカルボニル若しくはベンジルオキシであり；又は
　いずれか２つの隣接するR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、C_3～C_6シクロアルキル環若しくはフェニル環を形成し得、ここで、C_3～C_6シクロアルキル及びフェニル部分は、R^{10}により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３若しくは４つの基で任意に置換されていてもよく；又は
　いずれか２つの隣接するR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロアリール環を形成し得、ここで、ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２、３若しくは４個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員芳香族環であり、並びに、ここで、ヘテロアリール部分は、R^{10}により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３若しくは４つの基で任意に置換されていてもよく；又は
　いずれか２つの隣接するR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロシクリル環を形成し得、ここで、ヘテロシクリル部分は、Ｏ及びＮから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員であり、並びに、ここで、ヘテロシクリル環は、R^{10}により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３若しくは４つの基で任意に置換されていてもよく；
　R^{10}は、ハロゲン、C_1～C_3アルキル又はC_1～C_3アルコキシである）
の化合物、又はその塩若しくはＮ－オキシドが提供されている。

【０００４】

　意外なことに、式（Ｉ）の新規化合物は、実用的な目的について、きわめて有利なレベルの除草性活性を有することが見出された。

【０００５】

　本発明の第２の態様によれば、除草性有効量の本発明に係る式（Ｉ）の化合物を含む農薬組成物が提供される。このような農業組成物は、少なくとも１種の追加の有効成分及び／又は農芸化学的に許容可能な希釈剤若しくはキャリアをさらに含んでいてもよい。

【０００６】

　本発明の第３の態様によれば、生息地において雑草を防除する方法であって、生息地に、雑草防除量の式（Ｉ）の化合物を含む組成物を適用するステップを含む方法が提供される。

【０００７】

　本発明の第４の態様によれば、除草剤としての式（Ｉ）の化合物の使用が提供される。

【発明を実施するための形態】

【０００８】

置換基が「任意に置換されていてもよい」と記載されている場合、これは、１個以上の同等又は異なる置換基、例えば、１個、２個又は３個のR^{7}置換基を有していても有していなくてもよいことを意味する。例えば、１、２又は３個のハロゲンにより置換されているC$_1$～C$_6$アルキルとしては、特に限定されないが、－CH$_2$Cl、－CHCl$_2$、－CCl$_3$、－CH$_2$F、－CHF$_2$、－CF$_3$、－CH$_2$CF$_3$又は－CF$_2$CH$_3$基が挙げられ得る。他の例として、１、２又は３個のハロゲンにより置換されているC$_1$～C$_6$アルコキシとしては、特にこれらに限定されないが、CH$_2$ClO－、CHCl$_2$O－、CCl$_3$O－、CH$_2$FO－、CHF$_2$O－、CF$_3$O－、CF$_3$CH$_2$O－又はCH$_3$CF$_2$O－基が挙げられ得る。

【０００９】

本明細書において用いられるところ、「シアノ」と言う用語は、－CN基を意味する。

【００１０】

本明細書において用いられるところ、「ハロゲン」と言う用語は、フッ素（フルオロ）、塩素（クロロ）、臭素（ブロモ）又はヨウ素（ヨード）を指す。

【００１１】

本明細書において用いられるところ、「ヒドロキシ」又は「ヒドロキシル」と言う用語は、－OH基を意味する。

【００１２】

本明細書において用いられるところ、「ニトロ」と言う用語は、－NO$_2$基を意味する。

【００１３】

本明細書において用いられるところ、「アセチル」と言う用語は、－C（O）CH$_3$基を意味する。

【００１４】

本明細書において用いられるところ、＝Oは、例えばカルボニル（－C（＝O）－）基において見い出されるオキソ基を意味する。

【００１５】

本明細書において用いられるところ、「C$_1$～C$_6$アルキル」という用語は、炭素及び水素原子のみから構成され、不飽和を含まず、１～６個の炭素原子を有し、並びに、単結合によって分子の残部に結合している直鎖又は分岐鎖炭化水素鎖基を指す。「C$_1$～C$_4$アルキル」及び「C$_1$～C$_3$アルキル」も同様に解釈されるべきである。C$_1$～C$_6$アルキルの例としては、これらに限定されないが、メチル、エチル、ｎ－プロピル、及び、その異性体、例えば、イソプロピルが挙げられる。「C$_1$～C$_6$アルキレン」基はC$_1$～C$_6$アルキルの対応する定義を指すが、ただし、このような基は、２つの単結合によって分子の残部に結合していることを除く。「C$_1$～C$_2$アルキレン」という用語も同様に解釈されるべきである。C$_1$～C$_6$アルキレンの例としては、これらに限定されないが、－CH$_2$－、－CH$_2$CH$_2$－及び－（CH$_2$）$_3$－が挙げられる。

【００１６】

本明細書において用いられるところ、「C$_1$～C$_6$ハロアルキル」という用語は、１つ以上の同一又は異なるハロゲン原子により置換されている、一般的に上記に定義されているC$_1$～C$_6$アルキル基を指す。「C$_1$～C$_4$ハロアルキル」及び「C$_1$～C$_3$ハロアルキル」という用語も同様に解釈されるべきである。C$_1$～C$_6$ハロアルキルの例としては、これらに限定されないが、トリフルオロメチルが挙げられる。

【００１７】

本明細書において用いられるところ、「C$_1$～C$_6$アルコキシ」という用語は、R$_a$が一般的に上記に定義されているC$_1$～C$_6$アルキル基である式－OR$_a$の基を指す。「C$_1$～C$_4$アルコキシ」及び「C$_1$～C$_3$アルコキシ」という用語も同様に解釈されるべきである。C$_1$～C$_6$アルコキシの例としては、これらに限定されないが、メトキシ、エトキシ、１－メチルエトキシ（イソプロポキシ）及びプロポキシが挙げられる。

【００１８】

本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6ハロアルコキシ」という用語は、１つ以上の同一又は異なるハロゲン原子により置換されている、一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルコキシ基を指す。「C_1～C_4ハロアルコキシ」及び「C_1～C_3ハロアルコキシ」という用語も同様に解釈されるべきである。C_1～C_6ハロアルコキシの例としては、これらに限定されないが、トリフルオロメトキシが挙げられる。

【００１９】

本明細書において用いられるところ、「C_2～C_6アルケニル」という用語は、炭素及び水素原子のみから構成され、（Ｅ）－又は（Ｚ）－立体配置であることが可能である少なくとも１つの二重結合を含み、単結合によって分子の残部に結合している２～６個の炭素原子を有する直鎖又は分岐鎖炭化水素鎖基を指す。「C_2～C_3アルケニル」という用語も同様に解釈されるべきである。C_2～C_6アルケニルの例としては、これらに限定されないが、エテニル（ビニル）、プロプ－１－エニル、プロプ－２－エニル（アリル）、ブタ－１－エニルが挙げられる。

【００２０】

本明細書において用いられるところ、「C_2～C_6アルキニル」という用語は、炭素及び水素原子のみから構成され、少なくとも１つの三重結合を含有し、２～６個の炭素原子を有し、並びに、単結合によって分子の残部に結合している直鎖又は分岐鎖炭化水素鎖基を指す。「C_2～C_3アルキニル」という用語も同様に解釈されるべきである。C_2～C_6アルキニルの例としては、これらに限定されないが、エチニル、プロプ－１－イニル、ブタ－１－イニルが挙げられる。

【００２１】

本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキル」と言う用語は、式R_bOR_a－の基（式中、R_bは一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキル基であり、及び、R_aは、一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキレン基である）を指す。「C_1～C_4アルコキシC_1～C_4アルキル」及び「C_1～C_3アルコキシC_1～C_3アルキル」という用語は、同様に解釈されるべきである。

【００２２】

本明細書において用いられるところ、「C_3～C_6シクロアルキル」という用語は、単環式飽和環系であり、及び、３～６個の炭素原子を含有する基を指す。「C_3～C_5シクロアルキル」及び「C_3～C_4シクロアルキル」という用語も同様に解釈されるべきである。C_3～C_6シクロアルキルの例としては、これらに限定されないが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシルが挙げられる。

【００２３】

本明細書において用いられるところ、「C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル」と言う用語は、－ＮＨＣ（Ｏ）－リンカーを介して分子の残部に結合しているC_3～C_6シクロアルキル環を指す。C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニルの例としては、これらに限定されないが、シクロプロピルカルバモイル（すなわち、シクロプロピルアミノカルボニル）が挙げられる。

【００２４】

本明細書において用いられるところ、「フェニルC_1～C_2アルキル」と言う用語は、上記に定義されているC_1～C_2アルキレンリンカーを介して分子の残部に結合しているフェニル環を指す。フェニルC_1～C_2アルキルの例としては、これらに限定されないが、ベンジル及びフェニルエチルが挙げられる。

【００２５】

本明細書において用いられるところ、「ヘテロアリール」と言う用語は、窒素、酸素、及び硫黄から個々に選択される１、２又は３個のヘテロ原子を含む５員又は６員芳香族単環式環基を指す。ヘテロアリールの例としては、これらに限定されないが、フラニル、ピロリル、チエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、ピラジニル、ピリダジニル、ピリミジル又はピリジルが挙げられる。

【００２６】
本明細書において用いられるところ、「ヘテロアリールC_1～C_2アルキル」と言う用語は、上記に定義されているC_1～C_2アルキレンリンカーを介して分子の残部に結合している、一般的に上記に定義されているヘテロアリール環を指す。
【００２７】
本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルキルカルボニル」という用語は、R_aが一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキル基である式－Ｃ（Ｏ）R_aの基を指す。C_1～C_6アルキルカルボニルの例としては、これらに限定されないが、アセチルが挙げられる。
【００２８】
本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルコキシカルボニル」という用語は、R_aが一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキル基である式－Ｃ（Ｏ）ＯR_aの基を指す。
【００２９】
本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルキルアミノカルボニル」と言う用語は、式－Ｃ（Ｏ）ＮＨR_aの基（式中、R_aは一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキル基である）を指す。C_1～C_6アルキルアミノカルボニルの例としては、これらに限定されないが、エチルカルバモイル（すなわち、エチルアミノカルボニル）が挙げられる。
【００３０】
本明細書において用いられるところ、「Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_4アルキル）アミノ」と言う用語は、式－Ｎ（R_a）（R_b）の基（式中、各R_a及びR_bは、個別に、一般的に上記に定義されているC_1～C_4アルキル基である）を指す。「Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_3アルキル）アミノ」と言う用語は、同様に解釈されるべきである。
【００３１】
本明細書において用いられるところ、「Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_4アルキル）アミノカルボニル」と言う用語は、式－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R_a）（R_b）の基（式中、各R_a及びR_bは、個別に、一般的に上記に定義されているC_1～C_4アルキル基である）を指す。「Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_3アルキル）アミノカルボニル」と言う用語は同様に解釈されるべきである。Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_4アルキル）アミノカルボニルの例としては、これらに限定されないが、ジメチルカルバモイル（すなわちＮ，Ｎ－ジ（メチル）アミノカルボニル）が挙げられる。
【００３２】
本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルキルスルファニル」という用語は、R_aが一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキル基である式－ＳR_aの基を指す。「C_1～C_4アルキルスルファニル」及び「C_1～C_3アルキルスルファニル」という用語も同様に解釈されるべきである。C_1～C_6アルキルスルファニルの例としては、これらに限定されないが、メチルスルファニルが挙げられる。
【００３３】
本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルキルスルフィニル」という用語は、R_aが一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキル基である式－Ｓ（Ｏ）R_aの基を指す。「C_1～C_4アルキルスルフィニル」及び「C_1～C_3アルキルスルフィニル」という用語も同様に解釈されるべきである。C_1～C_6アルキルスルフィニルの例としては、これらに限定されないが、メチルスルフィニルが挙げられる。
【００３４】
本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルキルスルホニル」という用語は、R_aが一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキル基である式－Ｓ（Ｏ）$_2$$R_a$の基を指す。「$C_1$～$C_4$アルキルスルホニル」及び「$C_1$～$C_3$アルキルスルホニル」という用語も同様に解釈されるべきである。C_1～C_6アルキルソルファニル（ａｌｋｙｌｓｏｌｆａｎｙｌ）の例としては、これらに限定されないが、メチルスルホニルが挙げられる

。
【００３５】
本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルキルスルホンアミド」という用語は、式－ＮＨＳ（Ｏ）$_2R_a$の基を指し、R_aは一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキル基である。
【００３６】
１つ以上の可能なステレオジエン要素が式（Ｉ）の化合物に存在するとは、その化合物が光学異性形態、すなわち、鏡像異性形態又はジアステレオ異性形態をとり得ることを意味する。また、アトロプ異性体は、単結合に係る回転の制限によって生じ得る。式（Ｉ）は、すべてのこれらの可能性のある異性形態及びその混合物を含むことが意図されている。本発明は、式（Ｉ）の化合物に係るすべてのこれらの可能性のある異性形態及びその混合物を含む。同様に、式（Ｉ）は、すべての可能性のある互変異性体を含むことが意図されている。本発明は、式（Ｉ）の化合物に係るすべての可能性のある互変異性形態を含む。
【００３７】
各事例において、本発明に係る式（Ｉ）の化合物は、遊離形態、又は、塩形態、例えば農学的に使用可能な塩形態である。式（Ｉ）の化合物が、第一級、第二級及び第三級アミン（例えばアンモニア、ジメチルアミン及びトリエチルアミン）を含むアミン、アルカリ金属及びアルカリ土類金属塩基、遷移金属又は第四級アンモニウム塩基と形成し得る塩が好ましい。実施形態の特に好ましい組において、式（Ｉ）の化合物は、塩化物塩又は２，２，２－トリフルオロ酢酸塩を形成し得る。実施形態のさらに好ましい組において、式（Ｉ）の化合物は、２，２，２－トリフルオロ酢酸塩を形成し得る。
【００３８】
以下のリストは、式（Ｉ）の化合物を参照して、置換基R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、及びR^6に係る定義（好ましい定義を含む）を提供する。これらの置換基のいずれか１つについて、以下に記載の定義のいずれかは、本書面中以下又は他の箇所に記載されている、いずれかの他の置換基のいずれかの定義と組み合わされ得る。
【００３９】
R^1は、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキル又はC_3～C_6シクロアルキルである。好ましくは、R^1は、C_1～C_4アルキル、C_1～C_4アルコキシ、C_2～C_4アルケニル、C_2～C_4アルキニル、C_1～C_4アルコキシC_1～C_4アルキル又はC_3～C_6シクロアルキルである。より好ましくは、R^1は、C_1～C_4アルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_2～C_3アルケニル、C_2～C_3アルキニル、C_1～C_3アルコキシC_1～C_3アルキル又はC_3～C_4シクロアルキルである。
【００４０】
一組の実施形態において、R^1は、メチル、エチル、ｎ－プロピル、アリル、プロプ－２－イニル、メトキシ、メトキシエチル又はシクロプロピルである。実施形態の他の組において、R^1は、C_1～C_4アルキル、好ましくは、C_1～C_3アルキル、より好ましくは、メチル又はエチル、及び、さらにより好ましくは、エチルである。
【００４１】
R^2はフェニル又はヘテロアリールであり、ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２、３又は４個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員芳香族環であり、並びに、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^7により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３又は４個の基で任意に置換されていてもよい。
【００４２】
好ましくは、R^2はフェニル又はヘテロアリール（ここで、ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２又は３個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員芳香族環である）であり、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^7により表される同一であっても異なっていてもよい１、２又は３個の基で任意に置換されていてもよい。

【００４３】
より好ましくは、R^2はフェニル又はヘテロアリール（ここで、ヘテロアリール部分は、Ｎ及びＯから個々に選択される１又は２個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員芳香族環である）であり、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^7により表される同一であっても異なっていてもよい１、２又は３個の基で任意に置換されていてもよい。
【００４４】
さらにより好ましくは、R^2はフェニル又はヘテロアリールであり、ここで、ヘテロアリール部分は、Ｎ及びＯから個々に選択される１又は２個のヘテロ原子を含む５員又は６員芳香族環であり、並びに、ここで、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^7により表される、同一であっても異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよい。
【００４５】
さらにより好ましくは、R^2は、R^7により表される、同一であっても異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよいフェニルである。一組の実施形態において、R^2は、３－クロロ－４－シアノフェニル、３，４－ジクロロフェニル、３－クロロ－４－イソプロポキシフェニル又は３，４－ジフルオロフェニルである。好ましくは、R^2は、３－クロロ－４－シアノフェニル、３，４－ジクロロフェニル又は３，４－ジフルオロフェニル、より好ましくは３，４－ジクロロフェニルである。
【００４６】
R^3は水素又はC_1～C_6アルキルである。好ましくは、R^3は水素である。
【００４７】
R^4は、水素、ハロゲン、C_1～C_6アルキル又はC_1～C_6ハロアルキルである。好ましくは、R^4は、水素、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、又はC_1～C_3ハロアルキルである。より好ましくは、R^4は、水素又はC_1～C_3アルキルである。一組の実施形態において、R^4は、水素又はメチルである。実施形態の他の組において、R^4は水素である。
【００４８】
R^5はフェニル又はヘテロアリールであり、ここで、ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２、３又は４個のヘテロ原子を含む５員又は６員芳香族環であり、並びに、ここで、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^9により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３又は４つの基で任意に置換されていてもよく、並びに、ここで、R^5が５員ヘテロアリールである場合、ヘテロアリール部分は、炭素原子を介して分子の残部に結合しており。
【００４９】
好ましくは、R^5はフェニル又はヘテロアリールであり、ここで、ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２又は３個のヘテロ原子を含む５員又は６員芳香族環であり、並びに、ここで、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^9によって表される、同一であっても異なっていてもよい１、２又は３つの基で任意に置換されていてもよく、並びに、R^5が５員ヘテロアリールである場合、ヘテロアリール部分は炭素原子を介して分子の残部に結合している。
【００５０】
より好ましくは、R^5はフェニル又はヘテロアリールであり、ここで、ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１又は２個のヘテロ原子を含む５員又は６員芳香族環であり、並びに、ここで、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^9によって表される、同一であっても異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよく、並びに、ここで、R^5が５員ヘテロアリールである場合、ヘテロアリール部分は炭素原子を介して分子の残部に結合している。
【００５１】
さらにより好ましくは、R^5は、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラゾリル、チエニル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル又はイソオキサゾリルであり、ここで、前述のR^5基の各々は、R^9により表される、同一であ

っても異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよい。
【００５２】
さらにより好ましくは、R^5は、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル又はチアゾリルであり、ここで、前述のR^5基の各々は、R^9により表される、同一であっても異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよい。
【００５３】
一組の実施形態において、R^5は、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラゾリル、チエニル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル又はキノキサゾリニルであり、ここで、前述のR^5基の各々は、R^9により表される、同一であっても異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよい。
【００５４】
実施形態のさらなる組において、R^5は、フェニル、ピリジル、ピリミジニル又はチアゾリルであり、ここで、前述のR^5の各々は、R^9により表される、同一であっても異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよい。
【００５５】
R^5がヒドロキシ基で置換された６員ヘテロアリール部分である一定の実施形態において、この部分は、ケト（すなわち、ヒドロキシ基がオキソ基として現われる場合）又はエノール形態であり得る。この例は、R^5が６－オキソ－１Ｈ－ピリミジン－４－イル、６－オキソ－１Ｈ－ピリジン－２－イル又は６－オキソ－１Ｈ－ピリダジン－５－イルである場合、並びに、ピリミジニル、ピリジニル及びピリダジニル部分が、R^9により表されるさらなる基で置換され得る場合である。好ましくは、R^5がヒドロキシ基で置換された６員ヘテロアリール部分である場合、この部分は、ケト（すなわち、ヒドロキシ基がオキソ基として現われる場合）又はエノール形態であり得、R^5は、６－オキソ－１Ｈ－ピリミジン－４－イル、６－オキソ－１Ｈ－ピリジン－２－イル、５－シアノ－６－オキソ－１Ｈ－ピリジン－２－イル又は６－オキソ－１Ｈ－ピリダジン－５－イルである。
【００５６】
R^6は、水素、ハロゲン、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ又はC_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキルである。好ましくは、R^6は、水素、ハロゲン、C_1～C_4アルキル、C_1～C_4アルコキシ又はC_1～C_4アルコキシC_1～C_4アルキルである。より好ましくは、R^6は、水素、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシ又はC_1～C_3アルコキシC_1～C_3アルキルである。一実施形態において、R^6は水素又はC_1～C_3アルキル、好ましくは、水素又はメチルであり、及び、より好ましくは、R^6は水素である。
【００５７】
R^7は、シアノ、ニトロ、アミノ、ハロゲン、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルキルスルファニル、C_1～C_6アルキルスルフィニル、C_1～C_6アルキルスルホニル、C_1～C_6アルキルスルホンアミド、C_1～C_6アルキルカルボニル、C_1～C_6アルコキシカルボニル、C_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル、又はＮ，Ｎ－ジ（C_1～C_4アルキル）アミノカルボニルである。
【００５８】
好ましくは、R^7は、シアノ、ニトロ、アミノ、ハロゲン、C_1～C_4アルキル、C_1～C_4アルコキシ、C_1～C_4ハロアルキル、C_1～C_4ハロアルコキシ、C_1～C_4アルコキシC_1～C_3アルキル、C_1～C_4アルキルスルファニル、C_1～C_4アルキルスルフィニル、C_1～C_4アルキルスルホニル、C_1～C_4アルキルスルホンアミド、C_1～C_4アルキルカルボニル、C_1～C_4アルコキシカルボニル、C_1～C_4アルキルアミノカルボニル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル、又はＮ，Ｎ－ジ（C_1～C_3アルキル）アミノカルボニルである。
【００５９】

より好ましくは、R^7は、シアノ、ニトロ、アミノ、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_1～C_3ハロアルキル、C_1～C_3ハロアルコキシ、C_1～C_3アルコキシC_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルキルスルファニル、C_1～C_3アルキルスルフィニル、C_1～C_3アルキルスルホニル、C_1～C_3アルキルスルホンアミド、C_1～C_3アルキルカルボニル、C_1～C_3アルコキシカルボニル、C_1～C_3アルキルアミノカルボニル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル、又はＮ，Ｎ－ジ（C_1～C_3アルキル）アミノカルボニルである。

【００６０】

さらにより好ましくは、R^7は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_1～C_3ハロアルキル、C_1～C_3ハロアルコキシ、C_1～C_3アルコキシC_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルキルカルボニル又はC_3～C_6シクロアルキルである。さらにより好ましくは、R^7は、シアノ、ニトロ、クロロ、フルオロ、メチル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、２，２－ジフルオロエトキシ、メトキシメチル、アセチル又はシクロプロピルである。

【００６１】

一組の実施形態において、R^7は、シアノ、ハロゲン又はC_1～C_3アルコキシであり、好ましくは、シアノ、クロロ、フルオロ又はイソプロポキシである。

【００６２】

実施形態の他の組において、R^7は、シアノ、ニトロ又はハロゲンであり、好ましくは、R^7はハロゲンであり、より好ましくは、R^7はクロロ又はフルオロである。さらにより好ましくは、R^7はクロロである。

【００６３】

R^9は、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、ハロゲン、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルキルスルファニル、C_1～C_6アルキルスルフィニル、C_1～C_6アルキルスルホニル、C_1～C_6アルキルスルホンアミド、C_1～C_6アルキルカルボニル、C_1～C_6アルコキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル、C_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル、Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_4アルキル）アミノカルボニル若しくはベンジルオキシであり；又は

いずれか２つの隣接するR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、C_3～C_6シクロアルキル環若しくはフェニル環を形成し得、ここで、C_3～C_6シクロアルキル及びフェニル部分は、R^{10}により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３若しくは４つの基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれか２つの隣接するR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロアリール環を形成し得、ここで、ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２、３若しくは４個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員芳香族環であり、並びに、ここで、ヘテロアリール部分は、R^{10}により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３若しくは４つの基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれか２つの隣接するR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロシクリル環を形成し得、ここで、ヘテロシクリル部分は、Ｏ及びＮから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員であり、並びに、ここで、ヘテロシクリル環は、R^{10}により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３若しくは４つの基で任意に置換されていてもよい。

【００６４】

好ましくは、R^9は、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、ハロゲン、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_1～C_4アルコキシC_1～C_4アルキル、C_1～C_3アルキルスルファニル、C_1～C_3アルキルスルフィニル、C_1～C_3アルキルスルホニル、C_1～C_3アルキルスルホンアミド、C_1～C_4アルキ

ルカルボニル、C_1～C_4アルコキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル、C_1～C_4アルキルアミノカルボニル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル、Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_3アルキル）アミノカルボニル若しくはベンジルオキシであり；又は

いずれか２つの隣接するR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、C_3～C_6シクロアルキル環若しくはフェニル環を形成し得、ここで、C_3～C_6シクロアルキル及びフェニル部分は、R^{10}により表される同一であっても異なっていてもよい１、２若しくは３つの基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれか２つの隣接するR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロアリール環を形成し得、ここで、ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２若しくは３個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員芳香族環であり、並びに、ここで、ヘテロアリール部分は、R^{10}により表される同一であっても異なっていてもよい１、２若しくは３つの基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれか２つの隣接するR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロシクリル環を形成し得、ここで、ヘテロシクリル部分は、Ｏ及びＮから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員であり、並びに、ここで、ヘテロシクリル環は、R^{10}により表される同一であっても異なっていてもよい１、２若しくは３つの基で任意に置換されていてもよい。

【００６５】

より好ましくは、R^9は、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、ハロゲン、C_1～C_4アルキル、C_1～C_4アルコキシ、C_1～C_4ハロアルキル、C_1～C_4ハロアルコキシ、C_1～C_3アルコキシC_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルキルスルファニル、C_1～C_3アルキルスルフィニル、C_1～C_3アルキルスルホニル、C_1～C_3アルキルスルホンアミド、C_1～C_3アルキルカルボニル、C_1～C_3アルコキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル、C_1～C_3アルキルアミノカルボニル、C_3～C_4シクロアルキル、C_3～C_4シクロアルキルアミノカルボニル、Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_3アルキル）アミノカルボニル又はベンジルオキシである。

【００６６】

さらにより好ましくは、R^9は、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、ハロゲン、C_1～C_4アルキル、C_1～C_4アルコキシ、C_1～C_3ハロアルキル、C_1～C_3ハロアルコキシ、C_1～C_2アルコキシC_1～C_2アルキル、C_1～C_2アルキルスルファニル、C_1～C_2アルキルスルフィニル、C_1～C_2アルキルスルホニル、C_1～C_2アルキルスルホンアミド、C_1～C_2アルキルカルボニル、C_1～C_2アルコキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル、C_1～C_2アルキルアミノカルボニル、C_3～C_4シクロアルキル、C_3～C_4シクロアルキルアミノカルボニル、Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_2アルキル）アミノカルボニル又はベンジルオキシである。

【００６７】

一組の実施形態において、R^9は、シアノ、ヒドロキシ、ハロゲン、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルキルスルファニル、C_1～C_6アルキルスルホニル、C_1～C_6アルキルカルボニル、C_1～C_6アルコキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル又はC_3～C_6シクロアルキルである。好ましくは、R^9は、シアノ、ヒドロキシ、ハロゲン、C_1～C_4アルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_1～C_2ハロアルキル、C_1～C_2ハロアルコキシ、C_1～C_2アルコキシC_1～C_2アルキル、C_1～C_2アルキルスルファニル、C_1～C_2アルキルスルホニル、C_1～C_2アルキルカルボニル、C_1～C_2アルコキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル又はC_3～C_4シクロアルキルである。より好ましくは、R^9は、シアノ、ヒドロキシ、クロロ、フルオロ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_1～C_2ハロアルキル、トリフルオロメトキシ、メトキシメチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、アセチル、メトキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル又はシクロプロピルである。さらにより好ましくは、R^9は、シアノ、ヒドロキシ、クロ

ロ、フルオロ、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソプロピル、イソブチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、１－フルオロエチル、１，１－ジフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、メトキシメチル、メチルスルホニル、アセチル、メトキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル又はシクロプロピルである。

【００６８】

実施形態の他の組において、R^9は、ハロゲン、C_1～C_4アルキル、C_1～C_4アルコキシ、C_1～C_3ハロアルキル、C_1～C_3ハロアルコキシ、C_1～C_2アルキルスルファニル又はC_3～C_4シクロアルキルである。

【００６９】

実施形態のさらなる組において、R^9は、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、トリフルオロメチル、メチルスルファニル又はシクロプロピルである。

【００７０】

R^{10}は、ハロゲン、C_1～C_3アルキル又はC_1～C_3アルコキシである。好ましくは、R^{10}はハロゲン又はC_1～C_3アルコキシである。より好ましくは、R^{10}はハロゲン又はメトキシである。さらにより好ましくは、R^{10}はフルオロ又はメトキシである。

【００７１】

本発明による式（Ｉ）の化合物においては、好ましくは：

R^1はC_1～C_3アルキルであり；

R^2は、R^7により表される、同一であっても異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよいフェニルであり；

R^3は水素であり；

R^4は水素であり；

R^5はフェニル又はヘテロアリールであり、ここで、ヘテロアリール部分は、Ｎ及びＳから個々に選択される１又は２個のヘテロ原子を含む５員又は６員芳香族環であり、並びに、ここで、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^9により表される、同一であっても異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよく；

R^6は水素であり；

R^7はハロゲンであり；並びに

R^9は、ハロゲン、C_1～C_4アルキル、C_1～C_4アルコキシ、C_1～C_3ハロアルキル、C_1～C_3ハロアルコキシ、C_1～C_2アルキルスルファニル又はC_3～C_4シクロアルキルである。

【００７２】

実施形態の他の組において、

R^1はエチルであり；

R^2は３，４－ジクロロフェニルであり；

R^3は水素であり；

R^4は水素であり；

R^5はフェニル又はヘテロアリールであり、ここで、ヘテロアリール部分は、Ｎ及びＳから個々に選択される１又は２個のヘテロ原子を含む５員又は６員芳香族環であり、並びに、ここで、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^9により表される、同一であっても異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよく；

R^6は水素であり；並びに

R^9は、ハロゲン、C_1～C_4アルキル、C_1～C_4アルコキシ、C_1～C_3ハロアルキル、C_1～C_3ハロアルコキシ、C_1～C_2アルキルスルファニル又はC_3～C_4シクロアルキルである。

【００７３】

実施形態のさらなる組において、

R^1はエチルであり；

R^2は、３－クロロ－４－シアノフェニル、３，４－ジクロロフェニル、３－クロロ－４

－イソプロポキシフェニル又は３，４－ジフルオロフェニルであり；
R^3は水素であり；
R^4は水素であり；
R^5は、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラゾリル、チエニル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル又はキノキサゾリニルであり、ここで、前述のR^5基の各々は、R^9により表される、同一であっても異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよく；
R^9は、シアノ、ヒドロキシ、クロロ、フルオロ、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソプロピル、イソブチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、１－フルオロエチル、１，１－ジフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、メトキシメチル、メチルスルホニル、アセチル、メトキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル又はシクロプロピルである。

【００７４】

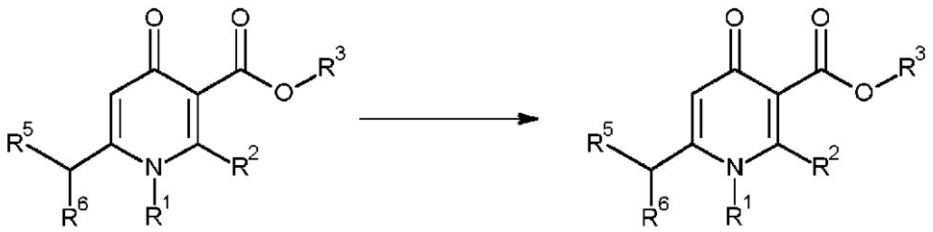
本発明の化合物は、以下のスキームにおいて示されているとおりに形成可能であり、ここでは、別段の定めがある場合を除き、各可変要素の定義は式（Ｉ）の化合物について上記に定義されているとおりである。式（Ｉ）の化合物を生成するための一般的な方法は以下に記載されている。文中に別段の定めがある場合を除き、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5及びR^6は、本明細書中において既に定義されているとおりである。本発明の化合物の調製に用いられる出発材料は、通常の商業的な供給業者から購入し得、又は、公知の方法により調製し得る。出発材料並びに中間体は、クロマトグラフィ、結晶化、蒸留及びろ過などの最先端の技法によって、次のステップにおいて使用される前に精製してもよい。

【００７５】

本発明の式（Ａ）の化合物は、スキーム１において以下に示されているとおり、式（Ａ）の化合物から調製され得る。

スキーム１：

【化２】



【００７６】

式（Ａ）の化合物（式中、R^3は水素であり、及び、R^5はアリール又はヘテロアリールである）は、任意の共溶剤（水など）を伴う好適な溶剤（メタノール、エタノール、ジクロロメタン、クロロホルム、酢酸エチル又はテトラヒドロフランなど）中における、好適な塩基（水酸化ナトリウム又は水酸化リチウムなど）又は好適な酸（トリフルオロ酢酸、塩酸、ギ酸又は硫酸など）による、式（Ａ）の化合物（式中、R^5はアリールであり、及び、R^3はC_1～C_6アルキルである）の加水分解により調製され得る。塩基を用いた場合、生成物は、好適な酸（塩酸など）による酸性化の後に得られた。

【００７７】

代替的な変換において、式（Ａ）の化合物（式中、R^3及びR^6は共に水素であり、並びに、R^5はアリール又はヘテロアリールである）は、任意の共溶剤（水など）を伴う好適な溶剤（メタノール、エタノール、ジクロロメタン、クロロホルム、酢酸エチル又はテトラヒドロフランなど）中における、好適な塩基（水酸化ナトリウム又は水酸化リチウムなど）又は好適な酸（トリフルオロ酢酸、塩酸、ギ酸又は硫酸など）による、式（Ａ）（式中、R^5はアリール又はヘテロアリールであり、R^3はC_1～C_6アルキルであり、及び

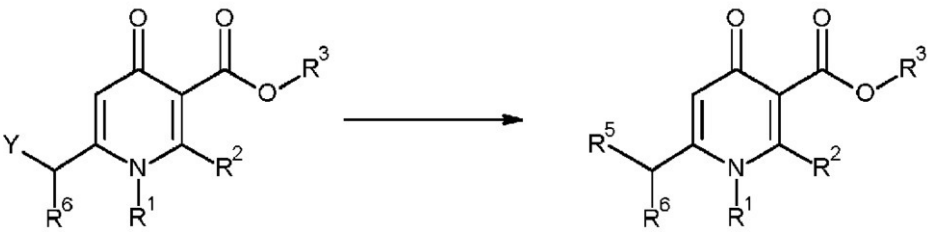
、Ｒ^{6}はエステルである）のワンポット加水分解－脱カルボキシル化反応により調製され得る。塩基を用いた場合、生成物は、好適な酸（塩酸など）による酸性化の後に得られた。

【００７８】

式（Ａ）の化合物はまた、以下に記載の方法によって調製され得る。

スキーム２：

【化３】



式(B)　　式(A)

【００７９】

式（Ｂ）の化合物（式中、ＹはＢｒ（又はＩ）であり、Ｒ^{3}はＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルであり、及び、Ｒ^{6}は水素である）は、文献による条件と同様のアリールボロン酸（（３－クロロフェニル）ボロン酸など）又はｈｅｔ－アリールボロン酸（（２－フルオロ－４－ピリジル）ボロン酸など）を伴う鈴木－宮浦クロスカップリングによって、式（Ａ）の化合物（式中、Ｒ^{5}はアリール又はヘテロアリールである）に転換され得る。典型的には、この反応は、任意にリガンド（（４－（Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノ）フェニル）ジ－ｔｅｒｔ－ブチルホスフィンなど）を伴う、好適な触媒（メタンスルホナト（１，１－ビス（ジ－ｔ－ブチルホスフィノ）フェロセン）（２’－アミノ－１，１’－ビフェニル－２－イル）パラジウム（ＩＩ）、４－ジｔｅｒｔ－ブチルホスファニル－Ｎ，Ｎ－ジメチルアニリン；メタンスルホン酸；Ｎ－メチル－２－フェニルアニリン；パラジウム又はクロロ［（トリ－ｔｅｒｔ－ブチルホスフィン）－２－（２－アミノビフェニル）］パラジウム（ＩＩ）など）、又は、二酢酸パラジウムの存在下に、塩基（リン酸三カリウムなど）の存在下、好適な有機溶剤（トルエン、アセトニトリル又はシクロペンチルメチルエーテルなど）中、任意に、水の存在下で、高い温度における、式（Ｂ）の化合物とＲ^{5}－ボロン酸又はボロキシンとの反応により行われる。これは、スキーム２において上記に示されている。

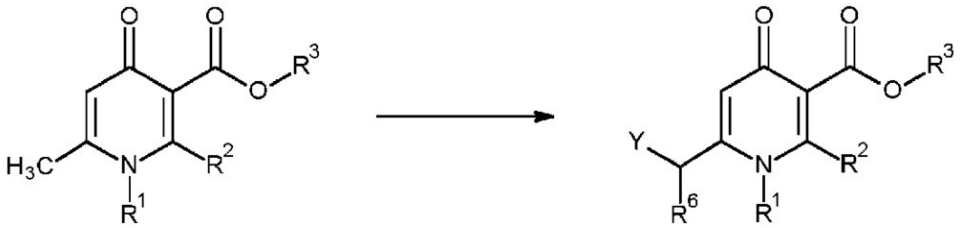
【００８０】

代替的な変換において、式（Ａ）の化合物（式中、Ｒ^{6}はエステル基（エステルカルボニルで結合）であり、及び、Ｒ^{5}はアリール又はヘテロアリールである）は、任意にリガンド（トリｔｅｒｔ－ブチルホスファン；テトラフルオロボレートなど）を伴う、好適な触媒（クロロ［（トリ－ｔｅｒｔ－ブチルホスフィン）－２－（２－アミノビフェニル）］パラジウム（ＩＩ）など）の存在下、塩基（リン酸三カリウムなど）の存在下、好適な溶剤（１，４－ジオキサン又は２－メチルブタン－２－オールなど）中、高い温度における、アリール又はヘテロアリールＲ^{5}－Ｘ（１－ブロモ－２－クロロ－ベンゼン又は１－クロロ－２－ヨードベンゼンなど）とのα－アリール化反応による、式（Ｂ）の化合物（式中、Ｙは水素であり、及び、Ｒ^{6}はエステル基（エステルカルボニルにより結合されている）である）の反応により入手され得る。

【００８１】

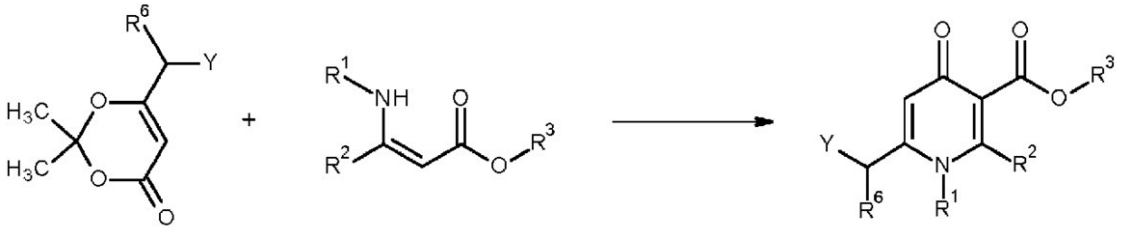
他の変換において、式（Ａ）の化合物（式中、Ｒ^{6}はエステル基（エステルカルボニルで結合）であり、及び、Ｒ^{5}はヘテロアリールである）は、塩基（リン酸三カリウムなど）の存在下、好適な溶剤（メチルスルフィニルメタンなど）中、高い温度における、Ｒ^{5}－Ｆ（５－クロロ－２－フルオロ－ピリジンなど）又はＲ^{5}－Ｃｌ（２，５－ジクロロピリミジンなど）を伴う求核性芳香族置換反応による、式（Ｂ）の化合物（式中、Ｙは水素であり、及び、Ｒ^{6}はエステル基（エステルカルボニルで結合）である）の反応によって

入手され得る。
【００８２】
スキーム３：
【化４】



式(C) 式(B)

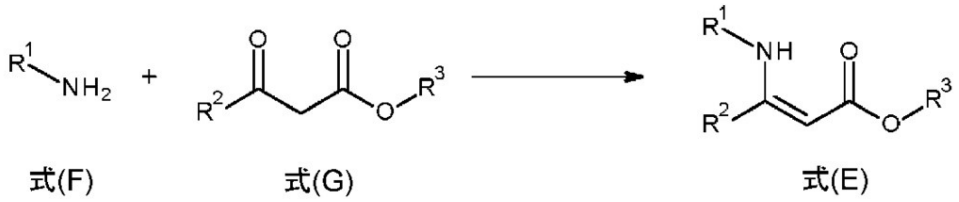
式（Ｃ）の化合物は、塩基（ビス（２，２，６，６－テトラメチル－１－ピペリジル）亜鉛、塩化マグネシウム又は塩化リチウムなど）の存在下、好適な溶剤（テトラヒドロフランなど）中、低い温度におけるエステルR^6－Ｃｌ（クロロギ酸エチルなど）との反応によって、式（Ｂ）の化合物（式中、R^6はエステル基（エステルカルボニルで結合）であり、及び、Ｙは水素である）に転換され得る。これは、スキーム３において上記に示されている。
【００８３】
他の変換において、式（Ｃ）の化合物は、塩基（ビス（２，２，６，６－テトラメチル－１－ピペリジル）亜鉛、塩化マグネシウム又は塩化リチウムなど）の存在下、好適な溶剤（テトラヒドロフランなど）中、低い温度におけるハロゲン化剤（ヨウ素など）との反応によって、式（Ｂ）の化合物（式中、Ｙはハロゲン（Ｂｒ又はＩなど）であり、及び、R^5は水素である）に転換され得る。
【００８４】
スキーム４：
【化５】



式(D) 式(E) 式(B)

式（Ｂ）の化合物（式中、Ｙはハロゲン（Ｂｒなど）であり、及び、R^6は水素、アリール又はヘテロアリールであり得る）は、任意に、好適な溶剤（キシレンなど）の存在下、高い温度（例えば１４０℃）で式（Ｄ）の化合物を式（Ｅ）の化合物と反応させることにより調製され得る。これは、スキーム４において上記に示されている。式（Ｄ）の化合物は市販されており、当業者に周知である方法によっても調製し得る。
【００８５】
スキーム５：

【化６】



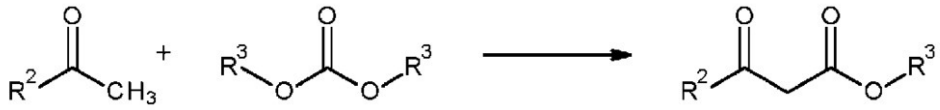
式(F) 式(G) 式(E)

式（Ｅ）の化合物は、式（Ｇ）のβ－ケトエステルとアミン塩との反応から調製され得る。アミン塩は、好適な酸（酢酸など）による、インサイチュでの式（Ｆ）のアミンの酸性化で調製可能である。これらのアミン塩は次いで、好適な溶剤（トルエンなど）中、酸（酢酸など）及び乾燥剤（４Å分子ふるいなど）の存在下で式（Ｇ）の化合物と反応させられ得る。これは、スキーム５において上記に示されている。式（Ｇ）の化合物は、市販されているか、又は、以下に記載の条件を用いて調製し得る。式（Ｆ）の化合物は市販されているか、又は、文献において報告されている方法により調製し得る。

【００８６】

スキーム６：

【化７】



式(H) 式(i) 式(G)

式（Ｇ）の化合物は、式（ｉ）の炭酸ジアルキル（炭酸ジメチルなど）の存在下における、塩基（水素化ナトリウムなど）による式（Ｈ）のケトンの処理により調製され得る。これは、スキーム６において上記に示されている。

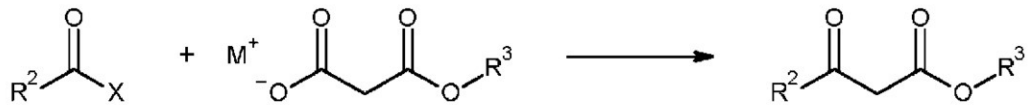
【００８７】

式（Ｈ）及び式（ｉ）の化合物は市販されており、当業者に周知である方法によっても調製し得る。

【００８８】

スキーム７：

【化８】



式(J) 式(K) 式(G)

式（Ｇ）の化合物は、室温、好適な溶剤（テトラヒドロフランなど）中における、任意のカップリング剤（１，１’－カルボニルジイミダゾールなど）による式（Ｊ）の化合物（式中、ＸはＯ又はＣｌである）の処理によって調製され得る。その後、中間体は、無機塩（塩化マグネシウムなど）の存在下、好適な溶剤（テトラヒドロフランなど）中、高い温度において、式（Ｋ）の化合物（３－メトキシ－３－オキソプロパン酸カリウムなど）と反応可能である。これは、スキーム７において上記に示されている。

【００８９】

式（Ｊ）及び式（Ｋ）の化合物は、市販されているか、又は、当業者に周知である方法により調製し得る。

【００９０】

本発明はさらに、生息地において雑草を防除する方法を提供するものであり、前記方法は、生息地に対する、雑草防除量の式（Ｉ）の化合物を含む組成物の適用を含む。しかも、本発明はさらに、有用な（作物）植物及び雑草が含まれる生息地において雑草を選択的に防除する方法を提供し得、ここで、この方法は、生息地に対する、雑草防除量の本発明に係る組成物の適用を含む。「防除」とは、駆除、成長の低減若しくは妨害、又は、発芽の防止若しくは低減を意味する。本発明の化合物は、公知の構造的に類似する化合物と比して、かなり向上した選択性を示すことに注目されたい。一般に、防除されるべき植物は、不要な植物（雑草）である。「生息地」とは、植物が成長しているか、又は、成長することとなる領域を意味する。施用は、作物植物の発芽前及び／又は発芽後に生息地に対して行われ得る。いく種かの作物植物は、式（Ｉ）の化合物による除草効果に対して先天的に耐性であり得る。

【００９１】

式（Ｉ）の化合物の施用量は広い限度内において様々であり得、土壌の性質、適用方法（発芽前又は発芽後；種子粉衣；蒔き溝への適用；耕耘適用無し等）、作物植物、防除されるべき雑草、卓越的気象条件、並びに、適用方法、適用時期及び標的作物によって左右される他の要因に応じる。本発明に係る式Ｉの化合物は一般に、１０～２５００ｇ／ｈａ、特に２５～１０００ｇ／ｈａ、特に２５～２５０ｇ／ｈａの量で適用される。

【００９２】

適用は一般に、典型的にはトラクタに備え付けた大面積用噴霧器によって組成物を吹き付けることにより行われるが、散粉（粉末の場合）、滴下又は潅注などの他の方法もまた使用可能である。

【００９３】

「有用な植物」という用語はまた、従来の交配又は遺伝子操作法によって、ブロモキシニルのような除草剤、又は、例えば、４－ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ（ＨＰＰＤ）阻害剤、ＡＬＳ阻害剤、例えばプリミスルフロン、プロスルフロン及びトリフロキシスルフロン、５－エノール－ピロビル－シキメート－３－リン酸塩－シンターゼ（ＥＰＳＰＳ）阻害剤、グルタミンシンテターゼ（ＧＳ）阻害剤若しくはプロトポルフィリノーゲン－オキシダーゼ（ＰＰＯ）阻害剤などのある分類の除草剤に対する耐性がもたらされた有用な植物を含むと理解されるべきである。従来の交配方法（突然変異誘発）によって、例えばイマザモックスといったイミダゾリノンに対する耐性がもたらされた作物の一例は、Ｃｌｅａｒｆｉｅｌｄ（登録商標）夏ナタネ（カノーラ）である。遺伝子操作方法によって除草剤又はあるクラスの除草剤に対する耐性がもたらされた作物の例としては、商品名ＲｏｕｎｄｕｐＲｅａｄｙ（登録商標）、Ｈｅｒｃｕｌｅｘ　Ｉ（登録商標）及びＬｉｂｅｒｔｙＬｉｎｋ（登録商標）で市販されているグリホサート－及びグルホシネート－耐性トウモロコシ品種が挙げられる。

【００９４】

「有用な植物」という用語は、例えば、特にバチルス属（Ｂａｃｉｌｌｕｓ）のものといったトキシン－産生バクテリア由来の公知のものなどの１種以上の選択的に作用するトキシンを合成可能であるよう、組み換えＤＮＡ技術を用いて形質転換された有用な植物をも含むと理解されるべきである。

【００９５】

このような植物の例は、ＹｉｅｌｄＧａｒｄ（登録商標）（ＣｒｙＩＡ（ｂ）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；ＹｉｅｌｄＧａｒｄ根食い線虫（登録商標）（ＣｒｙＩＩＩＢ（ｂ１）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；ＹｉｅｌｄＧａｒｄ　Ｐｌｕｓ（登録商標）（ＣｒｙＩＡ（ｂ）及びＣｒｙＩＩＩＢ（ｂ１）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；Ｓｔａｒｌｉｎｋ（登録商標）（Ｃｒｙ９（ｃ）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；Ｈｅｒｃｕｌｅｘ　Ｉ（登録商標）（ＣｒｙＩＦ（ａ２）トキシン及び酵素ホスフィノトリシンＮ－アセチルトランスフェラーゼ（ＰＡＴ）を発現して、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成しているトウモロコシ品種）；ＮｕＣＯＴＮ　３３Ｂ（登録商標）（ＣｒｙＩＡ（ｃ）トキシンを発現する綿品種）；Ｂｏｌｌｇ

ａｒｄ　Ｉ（登録商標）（ＣｒｙＩＡ（ｃ）トキシンを発現する綿品種）；Ｂｏｌｌｇａｒｄ　ＩＩ（登録商標）（ＣｒｙＩＡ（ｃ）及びＣｒｙＩＩＡ（ｂ）トキシンを発現する綿品種）；ＶＩＰＣＯＴ（登録商標）（ＶＩＰトキシンを発現する綿品種）；ＮｅｗＬｅａｆ（登録商標）（ＣｒｙＩＩＩＡトキシンを発現するジャガイモ品種）；ＮａｔｕｒｅＧａｒｄ（登録商標）Ａｇｒｉｓｕｒｅ（登録商標）ＧＴ利点（ＧＡ２１グリホサート耐性形質）、Ａｇｒｉｓｕｒｅ（登録商標）ＣＢ利点（Ｂｔ１１コーン穿孔性害虫（ＣＢ）形質）、Ａｇｒｉｓｕｒｅ（登録商標）ＲＷ（コーン根食い線虫形質）及びＰｒｏｔｅｃｔａ（登録商標）である。

【００９６】

植物作物又はその種子材料は共に、除草剤に耐性であると共に、同時に、昆虫による摂食（「スタック型」トランスジェニックイベント）に耐性であることが可能である。例えば、種子は、殺虫性Ｃｒｙ３タンパク質発現能を有する一方で、同時に、グリホサートに耐性であることが可能である。

【００９７】

作物植物はまた、交配又は遺伝子操作に係る従来の方法により得ることが可能であると共に、いわゆる出力形質（例えば向上した保管安定性、より高い栄養価、及び、向上した風味）を含むものを含むと理解されるべきである。

【００９８】

式（Ｉ）の化合物（又はこれを含む組成物）は、不要な植物（総括して「雑草」）の防除に用いることが可能である。防除される雑草は、例えばアグロスチス属（Ａｇｒｏｓｔｉｓ）、スズメノテッポウ属（Ａｌｏｐｅｃｕｒｕｓ）、カラスムギ属（Ａｖｅｎａ）、ブラキアリア属（Ｂｒａｃｈｉａｒｉａ）、スズメノチャヒキ属（Ｂｒｏｍｕｓ）、ケンクルス属（Ｃｅｎｃｈｒｕｓ）、カヤツリグサ属（Ｃｙｐｅｒｕｓ）、メヒシバ属（Ｄｉｇｉｔａｒｉａ）、エキノクロア属（Ｅｃｈｉｎｏｃｈｌｏａ）、オヒシバ属（Ｅｌｅｕｓｉｎｅ）、ドクムギ属（Ｌｏｌｉｕｍ）、モノコリア属（Ｍｏｎｏｃｈｏｒｉａ）、ロットボエリア属（Ｒｏｔｔｂｏｅｌｌｉａ）、オモダカ属（Ｓａｇｉｔｔａｒｉａ）、ホタルイ属（Ｓｃｉｒｐｕｓ）、セタリア属（Ｓｅｔａｒｉａ）及びモロコシ属（Ｓｏｒｇｈｕｍ）といった単子葉種、並びに、例えばイチビ属（Ａｂｕｔｉｌｏｎ）、アマランサス属（Ａｍａｒａｎｔｈｕｓ）、ブタクサ属（Ａｍｂｒｏｓｉａ）、アカザ属（Ｃｈｅｎｏｐｏｄｉｕｍ）、キク属（Ｃｈｒｙｓａｎｔｈｅｍｕｍ）、イズハハコ属（Ｃｏｎｙｚａ）、ヤエムグラ属（Ｇａｌｉｕｍ）、サツマイモ属（Ｉｐｏｍｏｅａ）、オランダガラシ属（Ｎａｓｔｕｒｔｉｕｍ）、シダ属（Ｓｉｄａ）、シロガラシ属（Ｓｉｎａｐｉｓ）、ナス属（Ｓｏｌａｎｕｍ）、ハコベ属（Ｓｔｅｌｌａｒｉａ）、クワガタソウ属（Ｖｅｒｏｎｉｃａ）、ビオラ属（Ｖｉｏｌａ）及びオナモミ属（Ｘａｎｔｈｉｕｍ）といった双子葉種の両方であり得る。

【００９９】

式（Ｉ）の化合物は、未変性の形態で使用され得るか、又は、好ましくは、除草組成物を提供するために配合物の当該技術分野において従来採用されている補助剤と一緒に、キャリア、溶剤及び表面活性薬剤（ＳＡＡ）などの配合補助剤を用いて、使用され得る。本発明は従って、少なくとも１種の式（Ｉ）の化合物と、農学的に許容可能なキャリアと、任意に補助剤とを含む除草組成物をさらに提供する。農業的に許容可能なキャリアは、例えば農業用の使用に好適なキャリアである。農業用キャリアは、当該技術分野において周知である。

【０１００】

除草組成物は一般に、０．１～９９重量％、特に０．１～９５重量％の式（Ｉ）の化合物と、好ましくは０～２５重量％の表面活性物質を含む１～９９．９重量％の配合補助剤とを含む。

【０１０１】

組成物は、多数の配合物タイプから選択可能である。これらとしては、エマルジョン濃縮物（ＥＣ）、懸濁液濃縮物（ＳＣ）、サスポエマルジョン（ＳＥ）、カプセル懸濁液（

ＣＳ）、水分散性顆粒（ＷＧ）、乳化性顆粒（ＥＧ）、油中水型エマルジョン（ＥＯ）、水中油型エマルジョン（ＥＷ）、マイクロ－エマルジョン（ＭＥ）、油分散体（ＯＤ）、混油性フロアブル剤（ＯＦ）、混油性液体（ＯＬ）、可溶性濃縮物（ＳＬ）、超低体積懸濁液（ＳＵ）、超低体積液体（ＵＬ）、工業用濃縮物（ＴＫ）、分散性濃縮物（ＤＣ）、可溶性粉末（ＳＰ）、水和剤（ＷＰ）及び可溶性顆粒（ＳＧ）が挙げられる。いずれかの事例において選択される配合物タイプは、想定される特定の目的、並びに、式（Ｉ）の化合物の物理的、化学的及び生物学的特性に応じることとなる。

【０１０２】

可溶性粉末（ＳＰ）は、式（Ｉ）の化合物を、１種以上の水溶性無機塩（重炭酸ナトリウム、炭酸ナトリウム又は硫酸マグネシウムなど）若しくは１種以上の水溶性有機固形分（多糖類など）、及び、任意により、１種以上の湿潤剤、１種以上の分散剤、又は、前記薬剤の混合物と混合して、水への分散性／溶解度を向上させることにより調製され得る。次いで、混合物は微粉末に粉砕される。同様の組成物を粒状化して、水溶性顆粒（ＳＧ）を形成することもできる。

【０１０３】

水和剤（ＷＰ）は、式（Ｉ）の化合物を、１種以上の固体希釈剤又はキャリア、１種以上の湿潤剤、並びに、好ましくは、１種以上の分散剤、及び、任意により、１種以上の懸濁剤と混合して、液体における分散性を促進させることにより調製され得る。次いで、混合物は微粉末に粉砕される。同様の組成物が粒状化されて、水分散性顆粒（ＷＧ）が形成されてもよい。

【０１０４】

顆粒（ＧＲ）は、式（Ｉ）の化合物と、１種以上の粉末固体希釈剤若しくはキャリアとの混合物を造粒することにより形成され得、又は、式（Ｉ）の化合物（又は、好適な薬剤中のその溶液）を多孔性の顆粒状材料（軽石、アタパルジャイトクレイ、フーラー土、キースラガー、珪藻土又は粉砕されたトウモロコシ穂軸など）中に吸収させ、若しくは、式（Ｉ）の化合物（又は、好適な薬剤中のその溶液）を硬質の核材料（砂、ケイ酸、炭酸塩鉱物、硫酸塩又はリン酸塩など）に吸収させ、必要に応じて乾燥させることにより予め形成されている圧縮粉顆粒から形成され得る。吸収又は吸着を助けるために通常用いられる薬剤としては、溶剤（脂肪族及び芳香族石油溶剤、アルコール、エーテル、ケトン、並びに、エステルなど）及び固着材（ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、デキストリン、糖質及び植物油など）が挙げられる。１種以上の他の添加剤もまた顆粒中に含まれていてもよい（例えば、乳化剤、湿潤剤又は分散剤）。

【０１０５】

分散性濃縮物（ＤＣ）は、式（Ｉ）の化合物を水、又は、ケトン、アルコール或いはグリコールエーテルなどの有機溶剤中に溶解させることにより調製され得る。これらの溶液は、表面活性剤を含有していてもよい（例えば、水による希釈を向上させるか、又は、噴霧タンク中での結晶化を防止するため）。

【０１０６】

乳化性濃縮物（ＥＣ）又は水中油型エマルジョン（ＥＷ）は、式（Ｉ）の化合物を有機溶剤（任意により、１種以上の湿潤剤、１種以上の乳化剤又は前記薬剤の混合物を有する）中に溶解させることにより調製され得る。ＥＣにおいて好適に用いられる有機溶剤としては、芳香族炭化水素（ＳＯＬＶＥＳＳＯ　１００、ＳＯＬＶＥＳＳＯ　１５０及びＳＯＬＶＥＳＳＯ　２００（ＳＯＬＶＥＳＳＯは登録商標である）により例示されるアルキルベンゼン又はアルキルナフタレンなど）、ケトン（シクロヘキサノン又はメチルシクロヘキサノンなど）、及び、アルコール（ベンジルアルコール、フルフリルアルコール又はブタノールなど）、Ｎ－アルキルピロリドン（Ｎ－メチルピロリドン又はＮ－オクチルピロリドンなど）、脂肪酸のジメチルアミド（C_8～C_{10}脂肪酸ジメチルアミドなど）、及び、塩素化炭化水素が挙げられる。ＥＣ生成物は、水に添加されると自然に乳化して、適切な器具での噴霧用途が可能なほどに十分な安定性を有するエマルジョンをもたらし得る。

【０１０７】

ＥＷの調製では、液体（室温で液体ではない場合には、典型的には７０℃未満といった適切な温度で溶融されていてもよい）として、又は、溶液（適切な溶剤中に溶解させることにより）で式（Ｉ）の化合物を得、次いで、得られた液体又は溶液が１種以上のＳＡＡを含有する水中に、高せん断下で乳化してエマルジョンがもたらされる。ＥＷにおいて好適に用いられる溶剤としては、植物油、塩素化炭化水素（クロロベンゼンなど）、芳香族溶剤（アルキルベンゼン又はアルキルナフタレンなど）、及び、水への溶解度が低い他の適切な有機溶剤が挙げられる。

【０１０８】

ミクロエマルジョン（ＭＥ）は、１種以上の溶剤と１種以上のＳＡＡとのブレンドを水と混合して、熱力学的に安定な等方性液体配合物を自然にもたらすことにより調製され得る。式（Ｉ）の化合物は、最初は、水又は溶剤／ＳＡＡブレンドのいずれかの中に存在している。ＭＥにおいて好適に用いられる溶剤としては、ＥＣ又はＥＷにおける使用について前述されているものが挙げられる。ＭＥは、水中油型又は油中水型系のいずれかであり得（どちらの系が存在しているかは、伝導率の測定によって判定され得る）、同一の配合物中の水溶性及び油溶性有害生物防除剤の混合に好適であればよい。ＭＥは、マイクロエマルジョンのままで、又は、従来の水中油型エマルジョンを形成して水中に好適に希釈される。

【０１０９】

懸濁液濃縮物（ＳＣ）は、式（Ｉ）の化合物の微細な不溶性固体粒子の水性又は不水性懸濁液を含んでいてもよい。ＳＣは、式（Ｉ）の固体化合物を、好適な媒体中で、任意により１種以上の分散剤と共にボールミル又はビーズミルにかけて、化合物の微細な粒子懸濁液をもたらすことにより調製され得る。１種以上の湿潤剤が組成物中に含まれていてもよく、懸濁剤が、粒子の沈降速度を低減するために含まれていてもよい。或いは、式（Ｉ）の化合物は、乾式ミルにかけられ、及び、明細書中に上述されている薬剤を含有する水に添加されることにより、所望の最終生成物がもたらされてもよい。

【０１１０】

エアロゾル配合物は、式（Ｉ）の化合物及び好適な噴射剤（例えばｎ－ブタン）を含む。式（Ｉ）の化合物はまた、好適な媒体（例えば水、又は、ｎ－プロパノールなどの水和性の液体）中に溶解又は分散されて、非加圧式の手動噴霧ポンプにおける使用のための組成物がもたらされてもよい。

【０１１１】

カプセル懸濁液（ＣＳ）は、ＥＷ配合物の調製と同様に調製され得るが、油滴の各々が高分子シェルに内包されており、式（Ｉ）の化合物と、任意により、これのためのキャリア又は希釈剤とが含有されている、油滴の水性分散体が得られるような追加の重合ステージが伴う。高分子シェルは、界面重縮合反応若しくはコアセルベーション手法の一方により生成され得る。組成物は式（Ｉ）の化合物の徐放をもたらし得、種子処理に用いられ得る。式（Ｉ）の化合物はまた、生分解性高分子マトリックス中に配合されて、化合物がゆっくりとした徐放性とされてもよい。

【０１１２】

組成物は、例えば、式（Ｉ）の化合物の濡れ性、保持性若しくは表面上での分布性；被処理表面上での雨に対する耐性；又は、摂取若しくは易動性を向上させることにより、組成物の生物学的性能を向上するために、１種以上の添加剤を含んでいてもよい。このような添加剤としては、表面活性剤（ＳＡＡ）、例えば一定の鉱油又は天然の植物油（大豆油及びナタネ油など）といった油系の噴霧添加剤、メチル化ナタネ油（ＭＲＳＯ）などの変性植物油、及び、これらと他の生体活性増強（ｂｉｏ－ｅｎｈａｎｃｉｎｇ）補助剤（式（Ｉ）の化合物の作用を補助若しくは改変し得る処方成分）とのブレンドが挙げられる。

【０１１３】

湿潤剤、分散剤及び乳化剤は、カチオン性、アニオン性、両性又はノニオン性のＳＡＡであり得る。

【０１１４】

好適なカチオン性のＳＡＡとしては、第四級アンモニウム化合物（例えばセチルトリメチルアンモニウムブロミド）、イミダゾリン及びアミン塩が挙げられる。

【０１１５】

好適なアニオン性ＳＡＡとしては、脂肪酸のアルカリ金属塩、脂肪族モノエステルの硫酸塩（例えばラウリル硫酸ナトリウム）、スルホン化芳香族化合物の塩（例えばドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム、ブチルナフタレンスルホネート、及び、ジ－イソプロピル－ナフタレンスルホン酸ナトリウムとトリ－イソプロピル－ナフタレンスルホン酸ナトリウムとの混合物）、エーテル硫酸塩、アルコールエーテル硫酸塩（例えばラウレス－３硫酸ナトリウム）、エーテルカルボキシレート（例えばラウレス－３炭酸ナトリウム）、リン酸エステル（例えば、ラウリルアルコールと四リン酸との反応といった１種以上の脂肪族アルコールとリン酸（主にモノエステル）又は五酸化リン（主にジ－エステル）との反応からの生成物；また、これらの生成物はエトキシル化されていてもよい）、スルホスクシナメート、パラフィン又はオレフィンスルホン酸塩、タウレート、リグノスルホネート、及び、トリスチリルフェノールのリン酸塩／硫酸塩が挙げられる。

【０１１６】

好適な両性ＳＡＡとしては、ベタイン、プロピオネート、及び、グリシネートが挙げられる。

【０１１７】

好適なノニオン性のＳＡＡとしては、エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシド、又は、これらの混合物などのアルキレンオキシドと、脂肪族アルコール（オレイルアルコール又はセチルアルコールなど）若しくはアルキルフェノール（オクチルフェノール、ノニルフェノール又はオクチルクレゾールなど）との縮合物；長鎖脂肪酸又はヘキシトール無水物由来の部分エステル；前記部分エステルとエチレンオキシドとの縮合物；ブロックポリマー（エチレンオキシド及びプロピレンオキシドを含む）；アルカノールアミド；単純エステル（例えば脂肪酸ポリエチレングリコールエステル）；アミンオキシド（例えばラウリルジメチルアミンオキシド）；レシチン並びにそのソルビタン及びエステル、アルキルポリグリコシド及びトリスチリルフェノールが挙げられる。

【０１１８】

好適な懸濁剤としては、親水性コロイド（多糖類、ポリビニルピロリドン又はナトリウムカルボキシメチルセルロースなど）及び膨潤粘土（ベントナイト又はアタパルジャイトなど）が挙げられる。

【０１１９】

本発明の化合物はまた、１種以上の追加の除草剤及び／又は植物成長調節剤との混合物で使用可能である。このような追加の除草剤又は植物成長調節剤の例としては、アセトクロール、アシフルオルフェン（アシフルオルフェン－ナトリウムを含む）、アクロニフェン、アメトリン、アミノカルバゾン、アミノピラリド、アミノトリアゾール、アトラジン、ベフルブタミド－Ｍ、ベンキトリオン、ベンスルフロン（ベンスルフロン－メチルを含む）、ベンタゾン、ビシクロピロン、ビラナホス、ビピラゾン、ビスピリバック－ナトリウム、ビクスロゾン、ブロクロゾン、ブロマシル、ブロモキシニル、ブタクロール、ブタフェナシル、カルフェントラゾン（カルフェントラゾン－エチルを含む）、クロランスラム（クロランスラム－メチルを含む）、クロリムロン（クロリムロン－エチルを含む）、クロロトルロン、クロルスルフロン、シンメチリン、クラシホス、クレトジム、クロジナホップ（クロジナホップ－プロパルギルを含む）、クロマゾン、クロピラリド、シクロピラニル、シクロピリモレート、シクロスルファムロン、シハロホップ（シハロホップ－ブチルを含む）、２，４－Ｄ（そのコリン塩及び２－エチルヘキシルエステルを含む）、２，４－ＤＢ、デスメディファム、ジカンバ（そのアルミニウム、アミノプロピル、ビス－アミノプロピルメチル、コリン、ジクロロプロプ、ジグリコールアミン、ジメチルアミン、ジメチルアンモニウム、カリウム及びナトリウム塩を含む）ジクロスラム、ジフルヘニカン、ジフルフェンゾピル、ジメタクロール、ジメテナミド－Ｐ、ジオキソピリトリオ、

ダイコートジブロミド、ジウロン、エピリフェナシル、エタルフルラリン、エトフメセート、フェノキサプロップ（フェノキサプロップ－Ｐ－エチルを含む）、フェノキサスルフォン、フェンピラゾン、フェンキノトリオン、フェントラザミド、フラザスルフロン、フロラスラム、フロルピラウキシフェン（フロルピラウキシフェン－ベンジルを含む）、フルアジホップ（フルアジホップ－Ｐ－ブチルを含む）、フルカルバゾン（フルカルバゾン－ナトリウムを含む）、フルクロラミノピル（フルクロラミノ－テフリルを含む）、フルフェナセット、フルフェノキシマシル、フルメツラム、フルミオキサジン、フルオメツロン、フォメサフェンフルピルスルフロン（フルピルスルフロン－メチル－ナトリウムを含む）、フルロキシピル（フルロキシピル－メプチルを含む）、フルスルフィナム、フォメサフェン、ホラムスルフロン、グルホシネート（Ｌ－グルホシネート及び両方のアンモニウム塩を含む）、グリホサート（そのジアンモニウム、イソプロピルアンモニウム及びカリウム塩を含む）、ハラウキシフェン（ハラウキシフェン－メチルを含む）、ハロキシホップ（ハロキシホップ－メチルを含む）、ヘキサジノン、ヒダントシジン、イカフォリン（イカフォリン－メチルを含む）、イマザモックス（Ｒ－イマザモックスを含む）、イマザピック、イマザピル、イマゼタピル、インダジフラム、インドロキシピル（インドロキシピル－シアノメチルを含む）、イオドスルフロン（イオドスルフロン－メチル－ナトリウムを含む）、イオフェンスルフロン（イオフェンスルフロン－ナトリウムを含む）、アイオキシニル、イプトリアゾピリド、イソプロツロン、イソキサフルトール、ランコトリオン、ＭＣＰＡ、ＭＣＰＢ、メコプロップ－Ｐ、メソスルフロン（メソスルフロン－メチルを含む）、メソトリオン、メタミトロン、メタザクロール、メチオゾリン、メトラクロール、メトスラム、メトリブジン、メトスルフロン、ナプロパミド、ニコスルフロン、ノルフラゾン、オキサジアゾン、オキサスルフロン、オキシフルオルフェン、パラコートジクロリド、ペンディメタリン、ペノキススラム、フェンメディファム、ピクロラム、ピノキサデン、プレチラクロール、プリミスルフロン－メチル、プロメトリン、プロパニル、プロパキザホップ、プロピリスルフロン、プロピザミド、プロスルホカルブ、プロスルフロン、ピラクロニル、ピラフルフェン（ピラフルフェン－エチルを含む）、ピラクイネート、ピラスルホトール、ピリデート、ピリフタリド、ピリフルベンゾキシム、ピリミスルファン、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、キザロホップ（キザロホップ－Ｐ－エチル及びキザロホップ－Ｐ－テフリルを含む）、リミソキサフェン、リムスルフロン、サフルフェナシル、セトキシジム、シマジン、Ｓ－メタロクロール（Ｓ－ｍｅｔａｌｏｃｈｌｏｒ）、スルフェントラゾン、スルホスルフロン、テブチウロン、テフリルトリオン、テンボトリオン、テルブチラジン、テルブトリン、テトフルピロリメト、チエンカルバゾン、チフェンスルフロン、チアフェナシル、トルピラレート、トプラメゾン、トラルコキシジム、トリアファモネ、トリアレート、トリアスルフロン、トリベヌロン（トリベヌロン－メチルを含む）、トリクロピル、トリフロキシスルフロン（トリフロキシスルフロン－ナトリウムを含む）、トリフルジモキサジン、トリフルラリン、トリフルスルフロン、トリピラスルホン、３－（２－クロロ－４－フルオロ－５－（３－メチル－２，６－ジオキソ－４－トリフルオロメチル－３，６－ジヒドロピリミジン－１（２Ｈ）－イル）フェニル）－５－メチル－４，５－ジヒドロイソキサゾール－５－カルボン酸エチルエステル、４－ヒドロキシ－１－メトキシ－５－メチル－３－［４－（トリフルオロメチル）－２－ピリジル］イミダゾリジン－２－オン、４－ヒドロキシ－１，５－ジメチル－３－［４－（トリフルオロメチル）－２－ピリジル］イミダゾリジン－２－オン、５－エトキシ－４－ヒドロキシ－１－メチル－３－［４－（トリフルオロメチル）－２－ピリジル］イミダゾリジン－２－オン、４－ヒドロキシ－１－メチル－３－［４－（トリフルオロメチル）－２－ピリジル］イミダゾリジン－２－オン、４－ヒドロキシ－１，５－ジメチル－３－［１－メチル－５－（トリフルオロメチル）ピラゾール－３－イル］イミダゾリジン－２－オン、（４Ｒ）１－（５－ｔｅｒｔ－ブチルイソキサゾール－３－イル）－４－エトキシ－５－ヒドロキシ－３－メチル－イミダゾリジン－２－オン、（１ＲＳ，５ＳＲ）－３－［２－メトキシ－４－（プロプ－１－イン－１－イル）フェニル］－４－オキソビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－２－イルメチルカー

ボネート、エチル－２－［［３－［［３－クロロ－５－フルオロ－６－［３－メチル－２，６－ジオキソ－４－（トリフルオロメチル）ピリミジン－１－イル］－２－ピリジル］オキシ］アセテート、メチル２－［２－［２－ブロモ－４－フルオロ－５－［３－メチル－２，６－ジオキソ－４－（トリフルオロメチル）ピリミジン－１－イル］フェノキシ］フェノキシ］－２－メトキシ－アセテート、６－クロロ－４－（２，７－ジメチル－１－ナフチル）－５－ヒドロキシ－２－メチル－ピリダジン－３－オン、（２－フルオロフェニル）メチル６－アミノ－５－クロロ－２－（４－クロロ－２－フルオロ－３－メトキシ－フェニル）ピリミジン－４－カルボキシレート、６－アミノ－５－クロロ－２－（４－クロロ－２－フルオロ－３－メトキシ－フェニル）ピリミジン－４－カルボン酸、並びに、メチル３－［２－クロロ－５－［３，６－ジヒドロ－３－メチル－２，６－ジオキソ－４－（トリフルオロメチル）－１（２Ｈ）－ピリミジニル］－４－フルオロフェニル］－３ａ，４，５，６－テトラヒドロ－６－メチル－６ａＨ－シクロペンタ［ｄ］イソオキサゾール－６ａ－カルボキシレートが挙げられる。

【０１２０】

式（Ｉ）の化合物の混合相手はまた、例えばＴｈｅ　Ｐｅｓｔｉｃｉｄｅ　Ｍａｎｕａｌ，Ｎｉｎｅｔｈｅｅｎｔｈ　Ｅｄｉｔｉｏｎ，Ｂｒｉｔｉｓｈ　Ｃｒｏｐ　Ｐｒｏｔｅｃｔｉｏｎ　Ｃｏｕｎｃｉｌ，２０２１において記載されているとおり、エステル又は塩の形態であってもよい。

【０１２１】

混合物は、上記の配合物において有利に用いられることが可能である（この場合、「有効成分」は式（Ｉ）の化合物と混合相手とのそれぞれの混合物に関連する）。

【０１２２】

本発明の化合物又は混合物は、１種以上の除草剤毒性緩和剤と組み合わせても使用可能である。このような毒性緩和剤の例としては、ベノキサコール、クロキントセット（クロキントセットメキシルを含む）、シプロスルファミド、ジクロルミド、フェンクロラゾール（フェンクロラゾール－エチルを含む）、フェンクロリム、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン（イソキサジフェン－エチルを含む）、メフェンピル（メフェンピル－ジエチルを含む）、メトカミフェン及びオキサベトリニルが挙げられる。式Ｉの化合物と、シプロスルファミド、イソキサジフェン－エチル、クロキントセットメキシル及び／又はメトカミフェンとの混合物が特に好ましい。

【０１２３】

式（Ｉ）の化合物の毒性緩和剤はまた、例えばＴｈｅ　Ｐｅｓｔｉｃｉｄｅ　Ｍａｎｕａｌ，１９^{h}　Ｅｄｉｔｉｏｎ（ＢＣＰＣ），２０２１に記載されているとおり、エステル又は塩の形態であり得る。クロキントセットメキシルに対する言及はまた、国際公開第０２／３４０４８号に開示されているとおり、そのリチウム、ナトリウム、カリウム、カルシウム、マグネシウム、アルミニウム、鉄、アンモニウム、第四級アンモニウム、スルホニウム又はホスホニウム塩にも適用される。

【０１２４】

好ましくは、式（Ｉ）の化合物対毒性緩和剤の混合比は、１００：１～１：１０、特に２０：１～１：１である。

【０１２５】

式（Ｉ）の化合物は通常農薬組成物の形態で用いられ、処理されるべき作物領域又は植物に、さらなる化合物と同時に、又は、順次に適用されることが可能である。これらのさらなる化合物は、例えば肥料若しくは微量元素供与物、又は、植物の成長に影響を及ぼす他の調製物であることが可能である。これらはまた、選択的な除草剤若しくは非選択的な除草剤、並びに、殺虫剤、殺菌・殺カビ剤、殺菌剤、殺線虫剤、軟体動物駆除剤、又は、これらの調製物の数種の混合物であることが可能であり、所望の場合には配合物の当該技術分野において慣例的に利用されるさらなるキャリア、界面活性剤若しくは適用促進補助剤を伴うことが可能である。

【０１２６】

本明細書において用いられる場合、「生息地」という用語は、植物が成長している圃場、又は栽培されている植物の種子が播種された圃場、又は種子が土壌に蒔かれることとなる圃場を意味する。これは、土壌、種子及び実生並びに確立した植生を含む。

【０１２７】

「植物」という用語は、種子、実生、苗、根、塊茎、茎、柄、群葉及び果実を含む植物のすべての物理的な部分を指す。

【０１２８】

「植物繁殖材料」という用語は、その増殖に用いられ得る種子などの植物の生殖部及び挿し木若しくは例えばジャガイモといった塊茎などの栄養体を表すと理解される。例えば種子（厳密な意味で）、根、果実、塊茎、鱗茎、根茎及び植物の部分が挙げられ得る。発芽後若しくは土壌から出芽した後に移植されることとなる発芽した植物及び若芽も挙げられる。これらの若芽は、移植前に浸漬による完全又は部分的な処置によって保護され得る。好ましくは、「植物繁殖材料」は、種子を表すと理解される。

【０１２９】

慣用名を用いて本明細書において言及される殺有害生物剤は、例えば、“Ｔｈｅ　Ｐｅｓｔｉｃｉｄｅ　Ｍａｎｕａｌ”，１９ｔｈ　Ｅｄ．，Ｂｒｉｔｉｓｈ　Ｃｒｏｐ　Ｐｒｏｔｅｃｔｉｏｎ　Ｃｏｕｎｃｉｌ　２０２１から公知である。

【０１３０】

式（Ｉ）の化合物は、未変性の形態で使用され得るか、又は、好ましくは、配合物の当該技術分野において従来採用されている補助剤と一緒に使用され得る。この目的のために、これらは、公知の様式において、乳化性濃縮物、コーティング用ペースト、直接噴射可能若しくは希釈可能な溶液又は懸濁液、希釈エマルジョン、水和剤、可溶性粉末、粉剤、粒質物及び例えば高分子物質中のカプセルに簡便に配合され得る。組成物のタイプと同様に、吹付け、霧吹き、散粉、散布、コーティング又は掛け流しなどの施用方法は、意図される目的及びその時点での状況に応じて選択される。組成物は、安定化剤、消泡剤、粘度調節剤、バインダ又は粘着剤並びに肥料、微量元素の供給源又は特別な効果を得るための他の配合物などのさらなる補助剤も含有し得る。

【０１３１】

例えば、農業に用いられる好適なキャリア及び補助剤は、固体又は液体であり得、配合技術において有用な物質であり、例えば天然若しくは再生ミネラル物質、溶剤、分散剤、湿潤剤、粘着剤、増粘剤、バインダ又は肥料である。このようなキャリアは、例えば、国際公開第９７／３３８９０号に記載されている。

【０１３２】

式（Ｉ）の化合物は、通常、組成物の形態で用いられ、処理されるべき作物領域又は植物にさらなる化合物と同時に又は順次に適用され得る。これらのさらなる化合物は、例えば、肥料若しくは微量元素供与物又は植物の成長に影響を及ぼす他の調製物であり得る。これらは、選択的な除草剤若しくは非選択的な除草剤並びに殺虫剤、殺菌・殺カビ剤、殺菌剤、殺線虫剤、軟体動物駆除剤又はこれらの調製物の数種の混合物でもあり得、所望の場合には、配合物の当該技術分野において慣例的に利用されるさらなるキャリア、界面活性剤若しくは施用促進補助剤を伴う。

【０１３３】

式（Ｉ）の化合物は、組成物における唯一の有効成分であり得、また適切な場合、殺有害生物剤、殺菌・殺カビ剤、共力剤、除草剤又は植物成長調節剤などの１種以上の追加の有効成分と混合され得る。追加の有効成分は、いくつかの場合、予期しない相乗的活性をもたらし得る。

【０１３４】

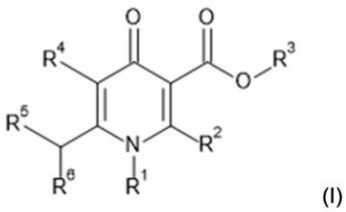
通常、配合物は、０．０１～９０重量％の有効薬剤、０～２０％の農学的に許容可能な界面活性剤並びに１０～９９．９９％の固体又は液体不活性配合物及び補助剤を含み、有効薬剤は、コンポーネント（Ｂ）及び（Ｃ）並びに任意に他の有効薬剤、特に殺菌剤又は防腐剤等を一緒に伴って少なくとも式（Ｉ）の化合物から構成される。組成物の濃縮形態

は、一般に、約２～８０％、好ましくは約５～７０重量％の有効薬剤を含有する。配合物の適用形態は、例えば、０．０１～２０重量％、好ましくは０．０１～５重量％の有効薬剤を含有し得る。市販製品は、濃縮物として配合されていることが好ましいであろうが、エンドユーザーは、通常、希釈した配合物を利用することとなる。

【０１３５】

以下の表は、本発明による個別の式（Ｉ）の化合物

【化９】



(I)

の例を例示する。

【０１３６】

【表１－１】

表 1:本発明に係る個別の式(I)の化合物

No.	R^1	R^2	R^4	R^5	R^6
001	Me	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(4-メトキシフェニル)	H
002	^{n}Pr	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(4-メトキシフェニル)	H
003	アリル	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(4-メトキシフェニル)	H
004	OMe	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(4-メトキシフェニル)	H
005	プロプ-2-イニル	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(4-メトキシフェニル)	H
006	2-メトキシエチル	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(4-メトキシフェニル)	H
007	^{c}Pr	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(4-メトキシフェニル)	H
008	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(4-メトキシフェニル)	Me
009	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	Me	(4-メトキシフェニル)	H
010	Et	(3,4-ジフルオロフェニル)	H	(4-メトキシフェニル)	H
011	Me	(3,4-ジフルオロフェニル)	H	(4-メトキシフェニル)	H
012	Et	(3,4-ジフルオロフェニル)	H	(4-メトキシフェニル)	Me
013	Et	(3,4-ジフルオロフェニル)	Me	(4-メトキシフェニル)	H
014	Et	(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)	H	(4-メトキシフェニル)	H
015	Me	(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)	H	(4-メトキシフェニル)	H
016	Et	(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)	H	(4-メトキシフェニル)	Me
017	Et	(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)	Me	(4-メトキシフェニル)	H
018	Me	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(3-クロロフェニル)	H
019	^{n}Pr	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(3-クロロフェニル)	H
020	アリル	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(3-クロロフェニル)	H
021	OMe	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(3-クロロフェニル)	H
022	プロプ-2-イニル	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(3-クロロフェニル)	H

【表１－２】

023	2-メトキシエチル	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(3-クロロフェニル)	H
024	^{c}Pr	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(3-クロロフェニル)	H
025	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(3-クロロフェニル)	Me
026	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	Me	(3-クロロフェニル)	H
027	Et	(3,4-ジフルオロフェニル)	H	(3-クロロフェニル)	H
028	Me	(3,4-ジフルオロフェニル)	H	(3-クロロフェニル)	H
029	Et	(3,4-ジフルオロフェニル)	H	(3-クロロフェニル)	Me
030	Et	(3,4-ジフルオロフェニル)	Me	(3-クロロフェニル)	H
031	Et	(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)	H	(3-クロロフェニル)	H
032	Me	(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)	H	(3-クロロフェニル)	H
033	Et	(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)	H	(3-クロロフェニル)	Me
034	Et	(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)	Me	(3-クロロフェニル)	H
035	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(5-メトキシ-2-ピリジル)	H
036	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(5-メトキシピリミジン-2-イル)	H
037	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(5-フルオロ-2-ピリジル)	H
038	Et	(3,4-ジフルオロフェニル)	H	(5-メトキシ-2-ピリジル)	H
039	Et	(3,4-ジフルオロフェニル)	H	(5-メトキシピリミジン-2-イル)	H
040	Et	(3,4-ジフルオロフェニル)	H	(5-フルオロ-2-ピリジル)	H
041	Et	(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)	H	(5-メトキシ-2-ピリジル)	H
042	Et	(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)	H	(5-メトキシピリミジン-2-イル)	H
043	Et	(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)	H	(5-フルオロ-2-ピリジル)	H
044	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(6-メトキシ-3-ピリジル)	H
045	Et	(3,4-ジフルオロフェニル)	H	(6-メトキシ-3-ピリジル)	H
046	Et	(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)	H	(6-メトキシ-3-ピリジル)	H

【表１－３】

047	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(6-フルオロ-3-ピリジル)	H
048	Et	(3,4-ジフルオロフェニル)	H	(6-フルオロ-3-ピリジル)	H
049	Et	(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)	H	(6-フルオロ-3-ピリジル)	H
050	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	[5-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]	H
051	Et	(3,4-ジフルオロフェニル)	H	[5-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]	H
052	Et	(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)	H	[5-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]	H
053	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(2-メトキシピリミジン-5-イル)	H
054	Et	(3,4-ジフルオロフェニル)	H	(2-メトキシピリミジン-5-イル)	H
055	Et	(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)	H	(2-メトキシピリミジン-5-イル)	H
056	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(6-メトキシピリダジン-3-イル)	H
057	Et	(3,4-ジフルオロフェニル)	H	(6-メトキシピリダジン-3-イル)	H
058	Et	(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)	H	(6-メトキシピリダジン-3-イル)	H
059	Et	(3-クロロ-4-ニトロ-フェニル)	H	(4-メトキシフェニル)	H
060	Et	(3-クロロ-4-ニトロ-フェニル)	H	(3-クロロフェニル)	H
061	Et	(3-クロロ-4-ニトロ-フェニル)	H	(5-メトキシ-2-ピリジル)	H
062	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]	H
063	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]	H
064	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(6-クロロ-3-ピリジル)	H
065	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	(5-クロロピラジン-2-イル)	H

【０１３７】

表Ａ－１は６５種の式（Ｉ）の化合物Ａ－１．００１～Ａ．１．０６５を提供し、ここで、R^3は水素であり、並びに、R^1、R^2、R^4、R^5及びR^6は表１に定義されているとおりである。

【０１３８】

配合例

【表２】

水和剤	a)	b)	c)
有効成分 [式(I)の化合物]	25 %	50 %	75 %
リグノスルホン酸ナトリウム	5 %	5 %	–
ラウリル硫酸ナトリウム	3 %	–	5 %
ナトリウムジイソブチルナフタレンスルホネート	–	6 %	10 %
フェノールポリエチレングリコールエーテル	–	2 %	–
(7 – 8 mol のエチレンオキシド)			
高分散ケイ酸	5 %	10 %	10 %
カオリン	62 %	27 %	–

【０１３９】
有効成分を補助剤と十分に混合し、混合物を好適なミルで十分に粉砕して、水で希釈して所望の濃度の懸濁液を得ることが可能である水和剤を得る。
【０１４０】
【表３】

乾燥種子処理に係る粉末	a)	b)	c)
有効成分[式(I)の化合物]	25 %	50 %	75 %
軽質鉱油	5 %	5 %	5 %
高分散ケイ酸	5 %	5 %	–
カオリン	65 %	40 %	–
タルカム	–		20 %

【０１４１】
有効成分補助剤と十分に混合し、混合物を好適なミルで十分に粉砕して、種子処理に直接用いることが可能である粉末を得る。
【０１４２】
乳化性濃縮物
有効成分［式（Ｉ）の化合物］　１０％
オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル　３％
（４～５ｍｏｌのエチレンオキシド）
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム　３％
ヒマシ油ポリグリコールエーテル（３５ｍｏｌのエチレンオキシド）　４％
シクロヘキサノン　３０％
キシレン混合物　５０％
【０１４３】
植物の保護に使用可能である、いずれかの必要とされる希釈度のエマルジョンは、水で希釈することによりこの濃縮物から入手が可能である。
【０１４４】

【表４】

粉剤	a)	b)	c)
有効成分[式(I)の化合物]	5％	6％	4％
タルカム	95％	–	–
カオリン	–	94％	–
無機充填材	–	–	96％

【０１４５】
直ちに使用可能な粉剤は、有効成分をキャリアと混合し、この混合物を好適なミル中において粉砕することにより得られる。このような粉末は、種子の乾燥粉衣にも用いることができる。
【０１４６】
押出し顆粒
有効成分［式（Ｉ）の化合物］　１５％
リグノスルホン酸ナトリウム　２％
カルボキシメチルセルロース　１％
カオリン　８２％
【０１４７】
有効成分を補助剤と混合及び粉砕し、この混合物を水で湿らせる。混合物を押し出し、次いで空気流中において乾燥させる。
【０１４８】
被覆顆粒
有効成分［式（Ｉ）の化合物］　８％
ポリエチレングリコール（ｍｏｌ．ｗｔ．２００）　３％
カオリン　８９％
【０１４９】
ミキサ中において、微細に粉砕した有効成分を、ポリエチレングリコールで湿らせたカオリンに均一に適用する。粉塵を発生させない被覆顆粒がこれにより得られる。
【０１５０】
懸濁液濃縮物
有効成分［式（Ｉ）の化合物］　４０％
プロピレングリコール　１０％
ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル（１５ｍｏｌのエチレンオキシド）　６％
リグノスルホン酸ナトリウム　１０％
カルボキシメチルセルロース　１％
シリコーン油（７５％水中エマルジョンの形態）　１％
水　３２％
【０１５１】
細かく粉砕した有効成分を補助剤と完全に混合して懸濁液濃縮物を得、これから、いずれかの所望の希釈率を有する懸濁液を水による希釈によって得ることが可能である。このような希釈により、生存している植物、並びに、植物繁殖材料を、吹付け、注ぎかけ、又は、浸漬により処理し、微生物による外寄生から保護することが可能である。
【０１５２】
種子処理用フロアブル剤濃縮物
有効成分［式（Ｉ）の化合物］　４０％
プロピレングリコール　５％

コポリマーブタノールＰＯ／ＥＯ　２％
トリスチレンフェノール＋　１０－２０モルＥＯ　２％
１，２－ベンズイソチアゾリン－３－オン（２０％水溶液の形態）　０．５％
モノアゾ顔料カルシウム塩　５％
シリコーン油（７５％水中エマルジョンの形態）　０．２％
水　４５．３％

【０１５３】

細かく粉砕した有効成分を補助剤と完全に混合して懸濁液濃縮物を得、これから、いずれかの所望の希釈率を有する懸濁液を水による希釈によって得ることが可能である。このような希釈を使用することにより、生存している植物、並びに、植物繁殖材料を、吹付け、注ぎかけ、又は、浸漬により処理し、微生物による外寄生から保護することが可能である。

【０１５４】

緩効性カプセル懸濁液

２８部の式（Ｉ）の化合物の組み合わせを、２部の芳香族溶剤及び７部のトルエンジイソシアネート／ポリメチレン－ポリフェニルイソシアネート混合物（８：１）と混合する。この混合物を、１．２部のポリビニルアルコール、０．０５部の脱泡剤及び５１．６部の水の混合物中に、所望の粒径が達成されるまで乳化させる。このエマルジョンに、５．３部の水中の２．８部の１，６－ジアミノヘキサンの混合物を添加する。混合物を重合反応が完了するまで撹拌する。得られるカプセル懸濁液を、０．２５部の増粘剤及び３部の分散剤を添加することにより安定化させる。このカプセル懸濁液配合物は、２８％の有効成分を含有する。中程度のカプセル径は８～１５ミクロンである。得られた配合物は、この目的のために好適な装置で水性懸濁液として種子に適用される。

【実施例】

【０１５５】

以下の非限定的な実施例は、以下の表２において参照される代表的な本発明の化合物の特定の合成方法を提供する。

【０１５６】

本明細書を通じて、温度は摂氏度（℃）で示し、「ｍ．ｐ．」は融点を意味する。

【０１５７】

略語リスト

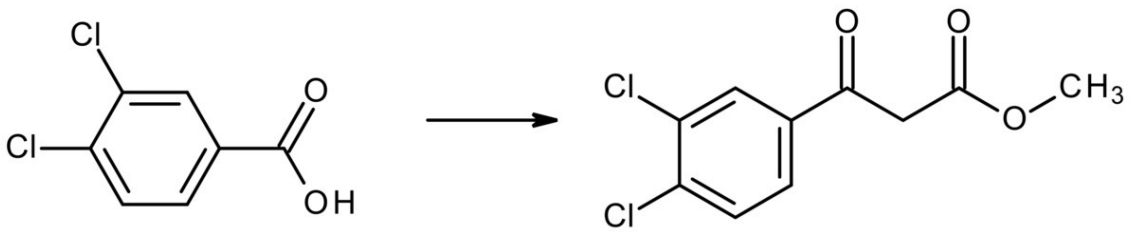
Å＝オングストローム、ｂｒｄ＝幅広の二重項、ｂｒｓ＝幅広の一重項、℃＝摂氏度、ｄ＝二重項、ｄｄ＝二重項の二重項、ＤＭＳＯ＝ジメチルスルホキシド、Ｍ＝モル量、ｍ＝多重項、ＭＨｚ＝メガヘルツ、ｎｍ＝ナノメートル、ｑ＝四重項、ｓ＝一重項、ｔ＝三重項。

【０１５８】

実施例１：６－［（３－クロロフェニル）メチル］－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸（化合物１）の合成

ステップ１：３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－オキソ－プロパン酸メチルの合成

【化１０】



窒素雰囲気下、及び、０℃に冷却した３，４－ジクロロ安息香酸（７．５７ｇ、３１．４ｍｍｏｌ）及びテトラヒドロフラン（６０ｍＬ）の撹拌溶液に、１，１’－カルボニル

ジイミダゾール（５．６０ｇ、３４．６ｍｍｏｌ）を数回に分けて添加した。反応混合物を室温に温め、１時間撹拌した。この時間の間、黄色の溶液からガスの発生が観察された。１時間後、反応混合物を、３－メトキシ－３－オキソプロパン酸カリウム（７．４１ｇ、４７．１ｍｍｏｌ）及び塩化マグネシウム（４．４９ｇ、４７．１ｍｍｏｌ）のテトラヒドロフラン（６０ｍＬ）中の撹拌溶液に、５０℃で滴下した。反応混合物を５０℃で２時間撹拌した。反応混合物を２Ｍの水性塩酸の添加により失活させ、次いで、酢酸エチルに抽出した。有機抽出物を塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、シクロヘキサン中の０～２０％酢酸エチルの勾配を溶離液として用いる、シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－オキソ－プロパン酸メチル（互変異性体の混合物）を無色の固体として得た。

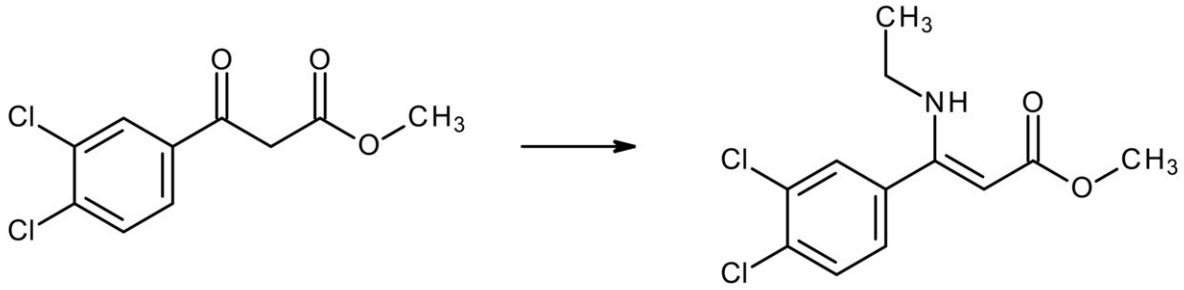
エノール：^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝１２．４８（ｓ，１Ｈ），７．８２－７．７１（ｍ，１Ｈ），７．５７－７．４９（ｍ，１Ｈ），７．４３（ｄ，１Ｈ），５．６１（ｓ，１Ｈ），３．７８（ｓ，３Ｈ）

ケト：^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．９８（ｄ，１Ｈ），７．８２－７．７１（ｍ，１Ｈ），７．５７－７．４９（ｍ，１Ｈ），３．９６（ｓ，２Ｈ），３．７３（ｓ，３Ｈ）

【０１５９】

ステップ２：メチル（Ｚ）－３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－（エチルアミノ）プロプ－２－エノエートの合成

【化１１】

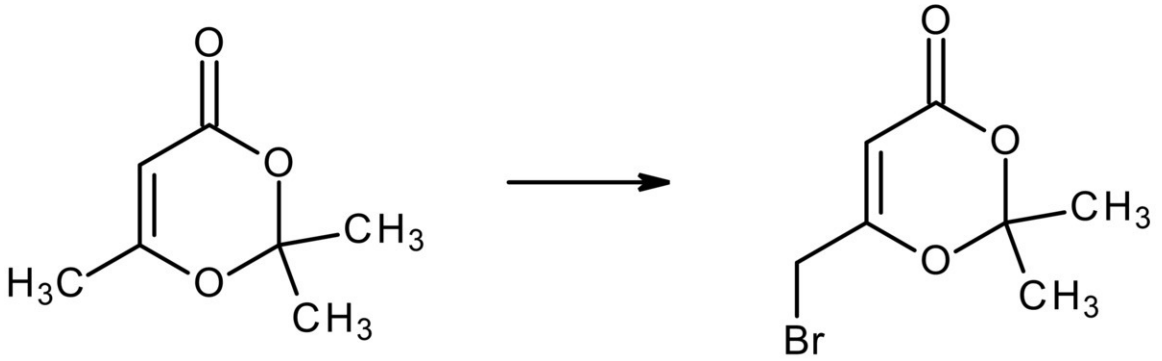


３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－オキソ－プロパン酸メチル（４．０３ｇ、１６．３ｍｍｏｌ）のトルエン（４６．８ｍＬ）中の撹拌溶液に、エチルアンモニウム；アセテート（４８．９ｍｍｏｌ）及び酢酸（１６．３ｍｍｏｌ）を添加した。スラリーを還流で３時間加熱した。冷却した反応混合物を酢酸エチルで希釈し、飽和重炭酸ナトリウム水溶液で洗浄した。相を分離し、有機相を塩水で洗浄した。有機抽出物を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、シクロヘキサン中の０～１０％酢酸エチルの勾配を溶離液として用いる、シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、メチル（Ｚ）－３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－（エチルアミノ）プロプ－２－エノエートを明るい黄色の油として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝８．３７（ｂｒｓ，１Ｈ），７．５０－７．４５（ｍ，２Ｈ），７．２０（ｄｄ，１Ｈ），４．５６（ｓ，１Ｈ），３．６８（ｓ，３Ｈ），３．１３－３．０１（ｍ，２Ｈ），１．１２（ｔ，３Ｈ）

【０１６０】

ステップ３：６－（ブロモメチル）－２，２－ジメチル－１，３－ジオキシン－４－オンの合成

【化１２】

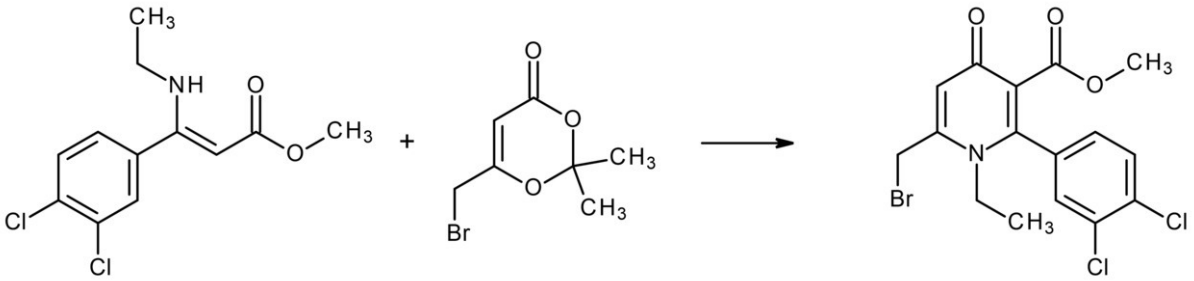


２，２，６－トリメチル－１，３－ジオキシン－４－オン（４．８８ｇ、３４．３ｍｍｏｌ）及びＮ－ブロモスクシンイミド（７．９４ｇ、４４．６ｍｍｏｌ）のジクロロメタン（１２０ｍＬ）中の撹拌溶液に、４５０ｎｍの光を室温で１２時間照射した。オレンジ色の反応混合物を飽和重炭酸ナトリウム水溶液及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液の５０：５０混合物で洗浄した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、水（＋０．１％ギ酸）中の３０～６０％アセトニトリル（＋０．１％ギ酸）の勾配を溶離液として用いる、Ｃ－１８シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、６－（ブロモメチル）－２，２－ジメチル－１，３－ジオキシン－４－オンを黄色の油として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝５．５４（ｓ，１Ｈ），３．９０（ｓ，２Ｈ），１．７３（ｓ，６Ｈ）

【０１６１】

ステップ４：メチル６－（ブロモメチル）－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートの合成

【化１３】

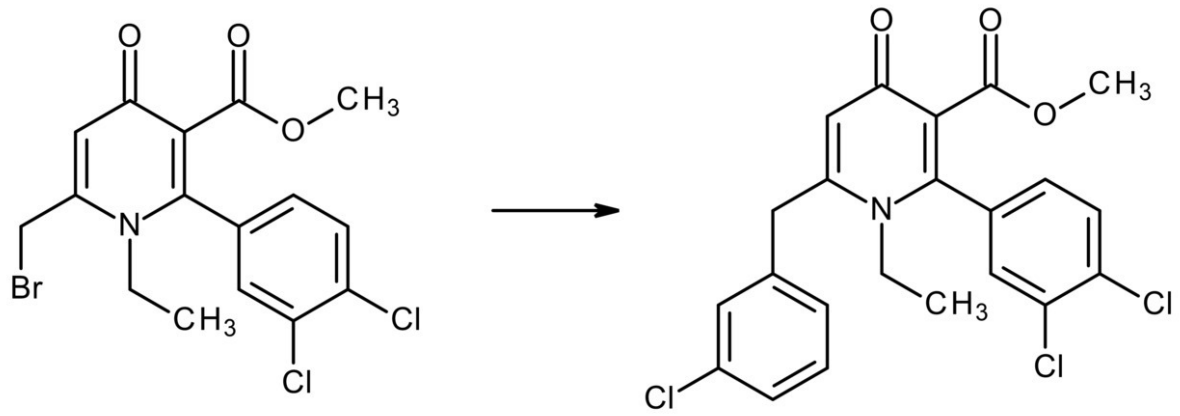


メチル（Ｚ）－３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－（エチルアミノ）プロプ－２－エノエート（０．７８０ｇ、２．８５ｍｍｏｌ）及び６－（ブロモメチル）－２，２－ジメチル－１，３－ジオキシン－４－オン（１．５７ｇ、７．１１ｍｍｏｌ）のキシレン（２８．５ｍＬ）中の撹拌混合物を、１４０℃で２分間加熱した。冷却した反応混合物を酢酸エチルで希釈し、塩水で洗浄した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、水（＋０．１％ギ酸）中の３０～６０％アセトニトリル（＋０．１％ギ酸）の勾配を溶離液として用いる、Ｃ－１８シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、メチル６－（ブロモメチル）－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートを黄色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（５００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．６０（ｄ，１Ｈ），７．５５（ｄ，１Ｈ），７．３３－７．２６（ｍ，１Ｈ），６．６８（ｓ，１Ｈ），４．４０（ｓ，２Ｈ），３．９９－３．８７（ｍ，２Ｈ），３．５５（ｓ，３Ｈ），１．２２（ｔ，３Ｈ）

【０１６２】

ステップ５：メチル６－［（３－クロロフェニル）メチル］－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートの合成

【化１４】

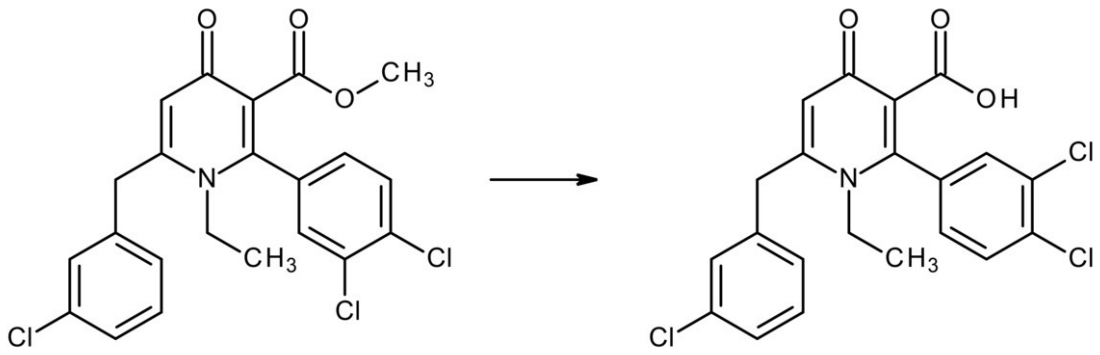


メチル６－（ブロモメチル）－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレート（０．０４２ｇ、０．１００ｍｍｏｌ）、（３－クロロフェニル）ボロン酸（０．０１６ｇ、０．１０５ｍｍｏｌ）及びクロロ［（トリ－ｔｅｒｔ－ブチルホスフィン）－２－（２－アミノビフェニル）］パラジウム（ＩＩ）（０．００３ｇ、０．００５ｍｍｏｌ）のメトキシシクロペンタン（０．８０ｍＬ）中の溶液に、窒素雰囲気下で、リン酸三カリウム（０．０６５ｇ、０．３００ｍｍｏｌ）の水（０．２０ｍＬ）中の溶液を添加した。撹拌した反応混合物を、６０℃で２０時間加熱した。冷却した反応混合物をセライトでろ過し、塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、水（＋０．１％ギ酸）中の３０～６０％アセトニトリル（＋０．１％ギ酸）の勾配を溶離液として用いる、Ｃ－１８シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、メチル６－［（３－クロロフェニル）メチル］－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートをクリーム色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．５９－７．５３（ｍ，１Ｈ），７．４８（ｄ，１Ｈ），７．３５－７．２９（ｍ，２Ｈ），７．２５－７．１８（ｍ，２Ｈ），７．１２－７．０５（ｍ，１Ｈ），６．４４（ｓ，１Ｈ），３．９８（ｓ，２Ｈ），３．６７（ｑ，２Ｈ），３．５７（ｓ，３Ｈ），１．０７（ｔ，３Ｈ）

【０１６３】

ステップ６：６－［（３－クロロフェニル）メチル］－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸の合成

【化１５】



メチル６－［（３－クロロフェニル）メチル］－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレート（０．０４２ｇ、０．０９３

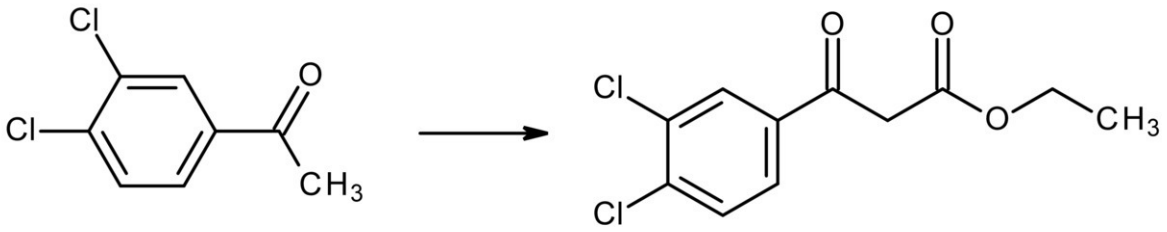
ｍｍｏｌ）のメタノール（０．９３ｍＬ）及び水（０．９３ｍＬ）の混合物中の溶液に、水酸化リチウム（０．０４０ｇ、０．９３ｍｍｏｌ）を添加した。得られた溶液を還流で１．５時間加熱した。冷却した反応混合物をジクロロメタン及び水で希釈し、２Ｍ水性塩酸の添加によりｐＨ１に酸性化し、その後、ジクロロメタンに抽出した。有機抽出物を減圧下で蒸発させて、６－［（３－クロロフェニル）メチル］－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸を黄色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．５７（ｄ，１Ｈ），７．３７－７．３１（ｍ，３Ｈ），７．１８（ｓ，１Ｈ），７．１２（ｄｄ，１Ｈ），７．０７（ｂｒ　ｄ，１Ｈ），６．５８（ｓ，１Ｈ），４．０８（ｓ，２Ｈ），３．７９（ｑ，２Ｈ），１．２２－１．１３（ｍ，３Ｈ）．

【０１６４】

実施例２：２－（３，４－ジクロロフェニル）－６－［（３，５－ジメトキシフェニル）メチル］－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸（化合物２）の合成

ステップ１：３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－オキソ－プロパン酸エチルの合成

【化１６】



窒素雰囲気下で、０℃に冷却した１－（３，４－ジクロロフェニル）エタノン（５．００ｇ、２６．５ｍｍｏｌ）及びジメチルカーボネート（４０ｍＬ、４６６ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、水素化ナトリウム（３．１７ｇ、７９．５ｍｍｏｌ、６０質量％）を数回に分けて添加した。反応混合物を室温に温め、１６時間撹拌した。一晩で、反応混合物は固体のペーストとなり撹拌は不可能であった。試みとしてジメチルカーボネート（１０ｍＬ）をさらに添加して失活のために流動性のスラリーを形成した。反応混合物を０℃に冷却し、窒素雰囲気下に水（２５ｍＬ）を添加して失活させた。２Ｍ水性塩酸の添加により、反応混合物をｐＨ３に酸性化し、次いで、酢酸エチルで抽出した。有機抽出物を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、溶離液として０～１５％のイソヘキサン中の酢酸エチルの勾配を用いるシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、メチル３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－オキソ－プロパノエート（互変異性体の混合物）を無色の液体として得た。

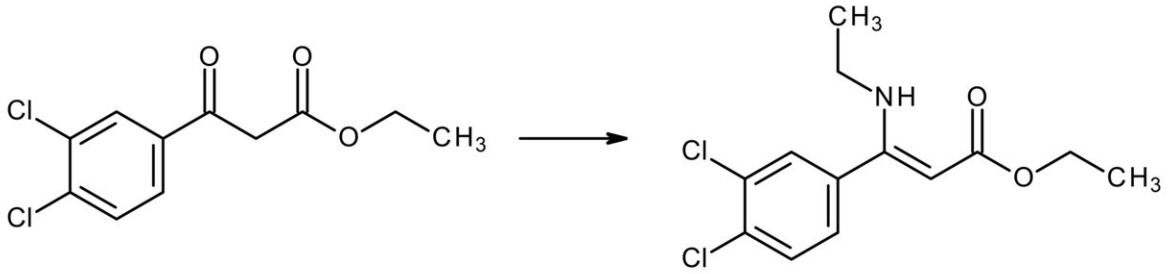
エノール：１Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝１２．４７（ｓ，１Ｈ），７．８７（ｄ，１Ｈ），７．５９（ｍ，３Ｈ），７．４９（ｄ，１Ｈ），５．６５（ｓ，１Ｈ），３．８２（ｓ，３Ｈ）

ケト：１Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝８．０３（ｄ，１Ｈ），７．７７（ｍ，１Ｈ），７．５８（ｄ，２Ｈ），３．９７（ｓ，２Ｈ），３．７６（ｓ，３Ｈ）

【０１６５】

ステップ２：エチル（Ｚ）－３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－（エチルアミノ）プロプ－２－エノエートの合成

【化１７】

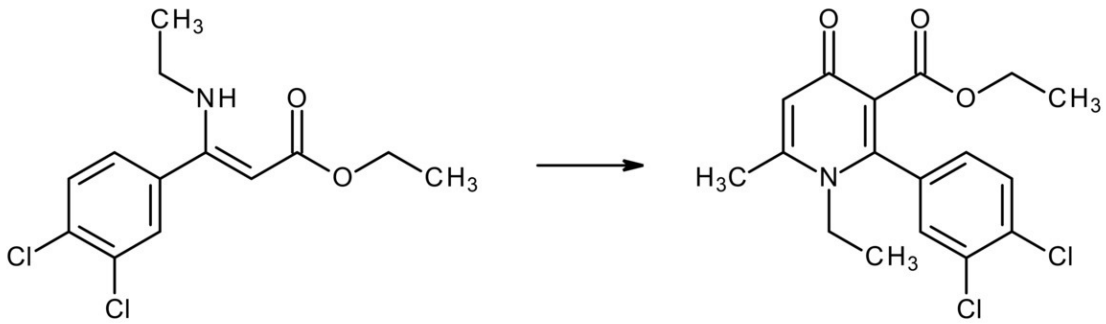


トルエン（１１ｍＬ）中のエチル３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－オキソ－プロパノエート（１．６５ｇ、６．３１９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、酢酸エチルアンモニウム（１９．０ｍｍｏｌ）及び酢酸（６．３２ｍｍｏｌ）を添加した。オレンジ色の反応混合物を還流で６時間加熱した。冷却した反応混合物を酢酸エチルで希釈し、飽和重炭酸ナトリウム水溶液で洗浄した。相を分離し、水性相を酢酸エチル（×３）で抽出した。有機抽出物を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、溶離液として０～１０％のシクロヘキサン中の酢酸エチルの勾配を用いるシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、エチル（Ｚ）－３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－（エチルアミノ）プロプ－２－エノエートを無色の油として得た。１Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．４９－７．４３（ｍ，２Ｈ），７．２３－７．１５（ｍ，１Ｈ），４．５８－４．５０（ｍ，１Ｈ），４．１７－４．０８（ｍ，２Ｈ），３．１２－２．９１（ｍ，２Ｈ），１．３１－１．２２（ｍ，３Ｈ），１．１５－１．０６（ｍ，３Ｈ）

【０１６６】

ステップ３：エチル２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートの合成

【化１８】



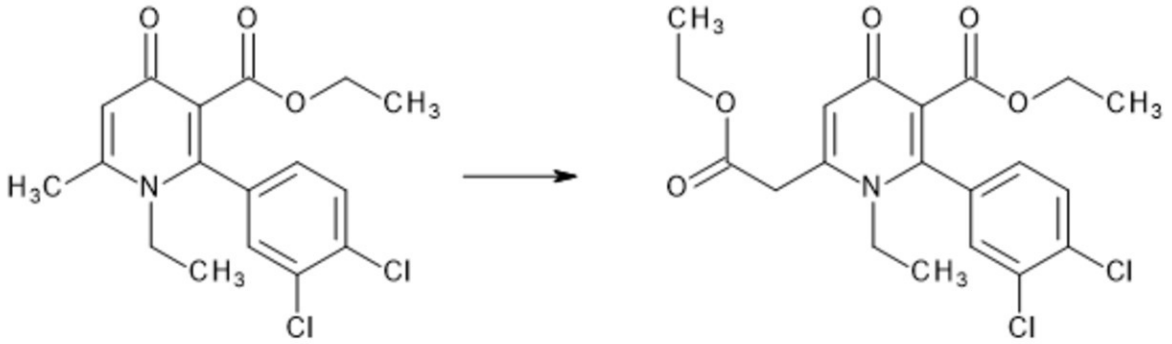
エチル（Ｚ）－３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－（エチルアミノ）プロプ－２－エノエート（０．５８３ｇ、２．０２ｍｍｏｌ）及び２，２，６－トリメチル－１，３－ジオキシン－４－オン（４．０５ｍｍｏｌ）の撹拌混合物を、窒素雰囲気下で、１２０℃で３時間加熱した。冷却した反応混合物を酢酸エチルで希釈し、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、溶離液として０～１０％のジクロロメタン中のメタノールの勾配を用いるシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、エチル２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートを茶色の固体として得た。１Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．５９（ｄ，１Ｈ），７．５３（ｄ，１Ｈ），７．２９（ｄｄ，１Ｈ），６．３９（ｓ，１Ｈ），４．０４－３．９５（ｍ，２Ｈ），３．７７（ｑ，２Ｈ），２．４４（ｓ，３Ｈ），１．１４（ｔ，３Ｈ），０．９７（ｔ，３Ｈ）

【０１６７】

ステップ４：エチル２－（３，４－ジクロロフェニル）－６－（２－エトキシ－２－オキ

ソーエチル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートの合成

【化１９】

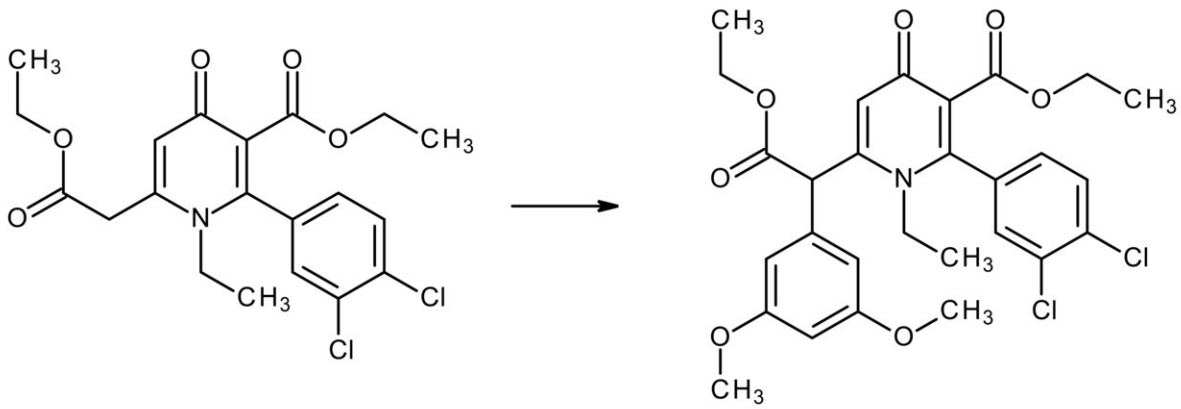


エチル２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレート（３．００ｇ、８．４７ｍｍｏｌ）のテトラヒドロフラン（４２ｍＬ）中の撹拌溶液に、－３０℃で、ビス（２，２，６，６－テトラメチル－１－ピペリジル）亜鉛．塩化マグネシウム．塩化リチウム（３７．０ｍＬ、１２．７ｍｍｏｌ）を滴下した。１５分後、クロロギ酸エチル（１．２１ｍＬ、１２．７ｍｍｏｌ）を赤色の溶液に添加した。反応混合物を０．７５時間撹拌し、その後、水及び酢酸エチルを反応混合物に添加し、これを室温に温めた。有機溶液を水性相から傾瀉し、水性相を酢酸エチルに抽出した。組み合わせた有機抽出物を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、水（＋０．１％ギ酸）中の４０～７０％アセトニトリル（＋０．１％ギ酸）の勾配を溶離液として用いる、Ｃ－１８シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、エチル２－（３，４－ジクロロフェニル）－６－（２－エトキシ－２－オキソ－エチル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートを黄色の固体として得た。１Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．５８（ｄ，１Ｈ），７．５５（ｄ，１Ｈ），７．２９（ｄｄ，１Ｈ），６．４４（ｓ，１Ｈ），４．２８－４．１７（ｍ，２Ｈ），４．０９－３．９７（ｍ，２Ｈ），３．７７（ｑ，２Ｈ），３．６８（ｓ，２Ｈ），１．３１（ｔ，３Ｈ），１．１２（ｔ，３Ｈ），０．９８（ｔ，３Ｈ）．

【０１６８】

ステップ５：エチル２－（３，４－ジクロロフェニル）－６－［１－（３，５－ジメトキシフェニル）－２－エトキシ－２－オキソ－エチル］－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートの合成

【化２０】



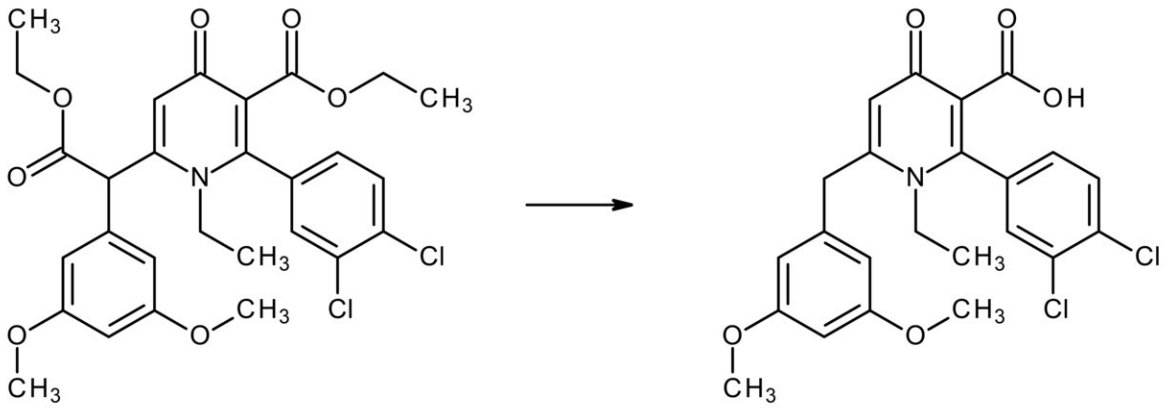
エチル２－（３，４－ジクロロフェニル）－６－（２－エトキシ－２－オキソ－エチル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレート（０．２００ｇ、０．４６９ｍｍｏｌ）、１－ブロモ－３，５－ジメトキシ－ベンゼン（０．１５３ｇ、０．７０

４ｍｍｏｌ）の１，４－ジオキサン（３．２８ｍＬ）中の撹拌溶液に、窒素雰囲気下で、クロロ［（トリ－ｔｅｒｔ－ブチルホスフィン）－２－（２－アミノビフェニル）］パラジウム（ＩＩ）（０．０２４ｇ、０．０４７ｍｍｏｌ）、トリｔｅｒｔ－ブチルホスフィンテトラフルオロボレート（０．０１４ｇ、０．０４７ｍｍｏｌ）及びリン酸三カリウム（０．２５４ｇ、１．１７３ｍｍｏｌ）を添加した。反応混合物を９５℃に３時間加熱した。冷却した反応混合物をろ過し、酢酸エチル中に溶解し、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、水（＋０．１％ギ酸）中の４５～７５％アセトニトリル（＋０．１％ギ酸）の勾配を溶離液として用いる、Ｃ－１８シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、エチル２－（３，４－ジクロロフェニル）－６－［１－（３，５－ジメトキシフェニル）－２－エトキシ－２－オキソ－エチル］－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートをクリーム色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．５８－７．４７（ｍ，２Ｈ），７．３０－７．１７（ｍ，１Ｈ），６．５２（ｄ，１Ｈ），６．４４（ｑ，１Ｈ），６．４０（ｄ，２Ｈ），４．９２（ｓ，１Ｈ），４．２７（ｍ，２Ｈ），４．０８－３．９６（ｍ，２Ｈ），３．７９（ｓ，３Ｈ），３．７９（ｓ，３Ｈ），３．７６－３．５６（ｍ，２Ｈ），１．３３－１．２６（ｍ，３Ｈ），１．１６－１．１０（ｍ，３Ｈ），０．９７（ｔ，３Ｈ）

【０１６９】

ステップ６：２－（３，４－ジクロロフェニル）－６－［（３，５－ジメトキシフェニル）メチル］－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸の合成

【化２１】



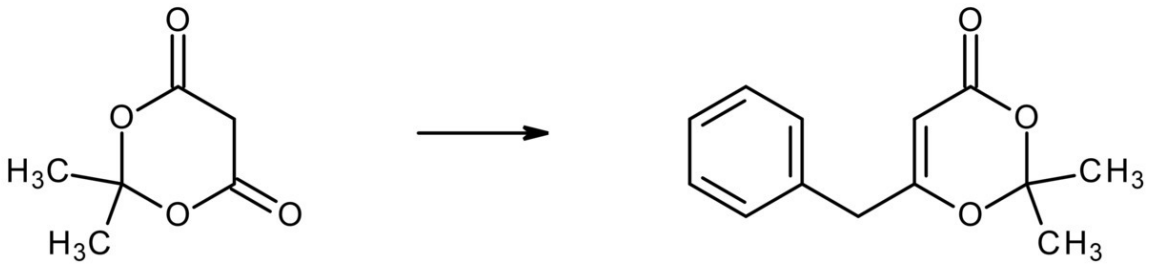
エチル２－（３，４－ジクロロフェニル）－６－［１－（３，５－ジメトキシフェニル）－２－エトキシ－２－オキソ－エチル］－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレート（０．０２４ｇ、０．０４３ｍｍｏｌ）のメタノール（０．４３ｍＬ）及び水（０．４３ｍＬ）の混合物中の溶液に、水酸化リチウム（０．０１８ｇ、０．４２３ｍｍｏｌ）を添加した。得られた溶液を還流で２時間加熱した。冷却した反応混合物をジクロロメタン及び水で希釈し、２Ｍ水性塩酸の添加によりｐＨ１に酸性化し、その後、ジクロロメタンに抽出した。有機抽出物を減圧下で蒸発させて、２－（３，４－ジクロロフェニル）－６－［（３，５－ジメトキシフェニル）メチル］－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸を無色の固体として得た。１Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．６２－７．５１（ｍ，１Ｈ），７．３６（ｄ，Ｊ＝２．０Ｈｚ，１Ｈ），７．１３（ｄｄ，Ｊ＝２．１，８．２Ｈｚ，１Ｈ），６．６６（ｓ，１Ｈ），６．４２（ｔ，Ｊ＝２．１Ｈｚ，１Ｈ），６．２９（ｄ，Ｊ＝２．１Ｈｚ，２Ｈ），４．０２（ｓ，２Ｈ），３．８５－３．８０（ｍ，２Ｈ），３．７８（ｓ，６Ｈ），１．１８（ｔ，Ｊ＝７．２Ｈｚ，３Ｈ）

【０１７０】

実施例３：６－ベンジル－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸（化合物３）の合成

ステップ１：６－ベンジル－２，２－ジメチル－１，３－ジオキシン－４－オンの合成

【化２２】

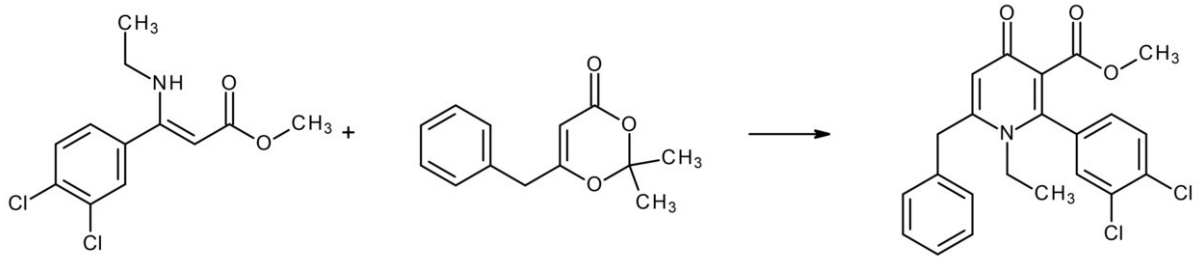


２，２－ジメチル－１，３－ジオキサン－４，６－ジオン（１．５０ｇ、１０．４ｍｍｏｌ）及びピリジン（１．６８ｍＬ、２０．８ｍｍｏｌ）の無水ジクロロメタン（７．５ｍＬ）中の撹拌混合物に、窒素雰囲気下、０℃で、２－フェニル塩化アセチルを添加した。反応混合物を０℃で１時間撹拌し、その後、室温に温め、さらに１時間撹拌した。反応混合物を冷たい２Ｍ水性塩酸にゆっくりと添加し、生成物をジクロロメタンに抽出した。有機抽出物を減圧下で蒸発させて、粗５－（１－ヒドロキシ－２－フェニル－エチリデン）－２，２－ジメチル－１，３－ジオキサン－４，６－ジオンを得た。無水トルエン（７．５ｍＬ）中の粗５－（１－ヒドロキシ－２－フェニル－エチリデン）－２，２－ジメチル－１，３－ジオキサン－４，６－ジオンに無水アセトン（０．３０２ｇ、５．２０ｍｍｏｌ）を添加し、混合物を１時間加熱還流した。冷却した反応混合物を減圧下で蒸発させ、イソヘキサン中の０～３０％酢酸エチルの勾配を溶離液として用いる、シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、６－ベンジル－２，２－ジメチル－１，３－ジオキシン－４－オンを黄色の油として得た。１Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．３６－７．２８（ｍ，３Ｈ），７．２４－７．１９（ｍ，２Ｈ），５．２０（ｔ，１Ｈ），３．５０（ｓ，２Ｈ），１．６１（ｓ，６Ｈ）

【０１７１】

ステップ２：メチル６－ベンジル－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートの合成

【化２３】

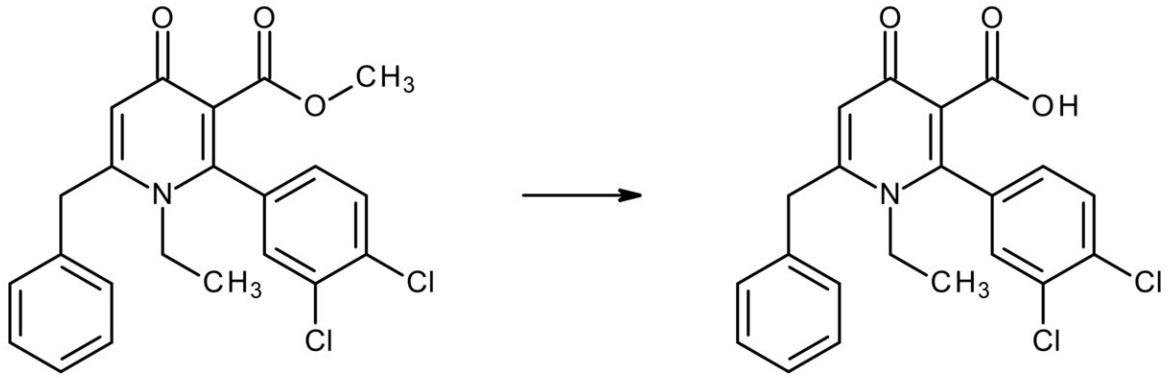


窒素雰囲気下で、メチル（Ｚ）－３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－（エチルアミノ）プロプ－２－エノエート（０．５５０ｇ、２．０１ｍｍｏｌ）及び６－ベンジル－２，２－ジメチル－１，３－ジオキシン－４－オン（０．５２５ｇ、２．４１ｍｍｏｌ）の撹拌混合物を１２０℃で２時間加熱した。冷却した反応混合物を減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、ジクロロメタン中の０～１０％メタノールの勾配を溶離液として用いる、シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、メチル６－ベンジル－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートを茶色の固体として得た。１Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．５３（ｄ，１Ｈ），７．４７（ｄ，１Ｈ），７．４０－７．３５（ｍ，２Ｈ），７．３４－７．２８（ｍ，１Ｈ），７．２３－７．１７（ｍ，３Ｈ），６．４４（ｓ，１Ｈ），３．９９（ｓ，２Ｈ），３．６５（ｑ，２Ｈ），３．５７（ｓ，３Ｈ），１．０４（ｔ，３Ｈ）

【０１７２】

ステップ３：６－ベンジル－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸の合成

【化２４】



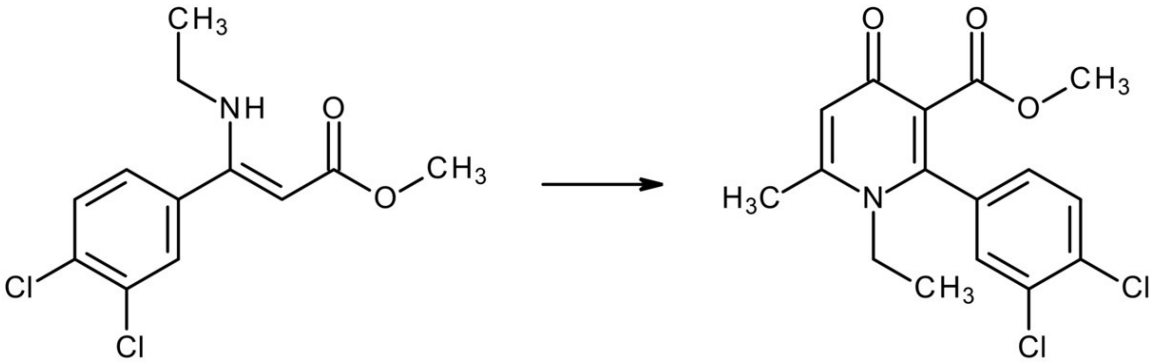
メチル６－ベンジル－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレート（０．２２０ｇ、０．５２８ｍｍｏｌ）のメタノール（１．８９ｍＬ）及び水（１．４３ｍＬ）の混合物中の溶液に、水酸化リチウム（０．０４４ｇ、１．０６ｍｍｏｌ）を添加した。得られた溶液を還流で４．５時間加熱した。冷却した反応混合物を減圧下で乾燥するまで蒸発させ、ジエチルエーテルで倍散した。固体残渣を水中に溶解し、２Ｍ水性塩酸の添加によりｐＨ３に酸性化し、その後、ジクロロメタンに抽出した。有機抽出物を減圧下で乾燥するまで蒸発させて、６－ベンジル－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸をオフホワイトの固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．５７（ｄ，１Ｈ），７．４４－７．３１（ｍ，４Ｈ），７．２３－７．０９（ｍ，３Ｈ），６．６６（ｓ，１Ｈ），４．１１（ｓ，２Ｈ），３．８１（ｑ，２Ｈ），１．１７（ｔ，３Ｈ）

【０１７３】

実施例４：６－［（５－クロロピリミジン－２－イル）メチル］－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸（化合物４）の合成

ステップ１：メチル２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートの合成

【化２５】



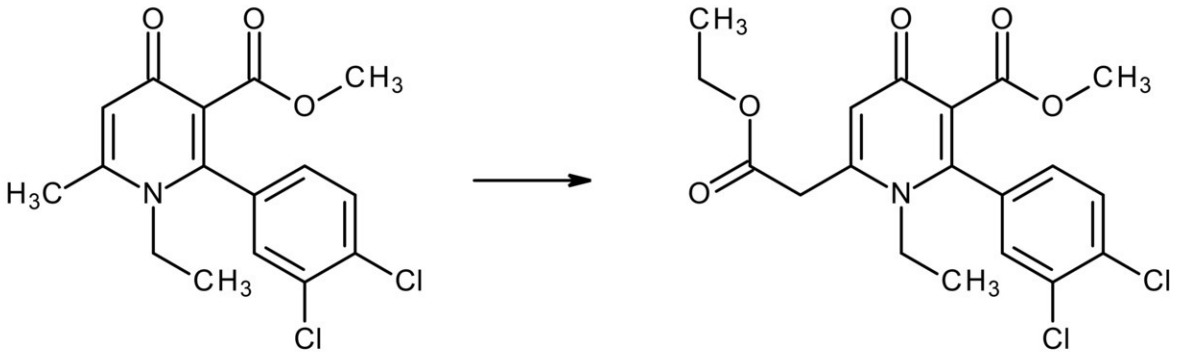
メチル（Ｚ）－３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－（エチルアミノ）プロプ－２－エノエート（３．３８ｇ、１２．３ｍｍｏｌ）及び２，２，６－トリメチル－１，３－ジオキシン－４－オン（２．４６ｍＬ、１８．５ｍｍｏｌ）の混合物を、窒素雰囲気下で、１２０℃で１時間加熱した。冷却した反応混合物を減圧下で蒸発させ、得られた赤色のガムを、ジクロロメタン中の０～１０％メタノールの勾配を溶離液として用いる、シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、メチル２－（３，４－ジクロ

ロフェニル）－１－エチル－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートをオレンジ色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．５９（ｄ，１Ｈ），７．５０（ｄ，１Ｈ），７．２２（ｄｄ，１Ｈ），６．４２（ｓ，１Ｈ），３．７４（ｑ，２Ｈ），３．５８（ｓ，３Ｈ），２．４２（ｓ，３Ｈ），１．１２（ｔ，３Ｈ）

【０１７４】

ステップ２：メチル２－（３，４－ジクロロフェニル）－６－（２－エトキシ－２－オキソ－エチル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートの合成

【化２６】

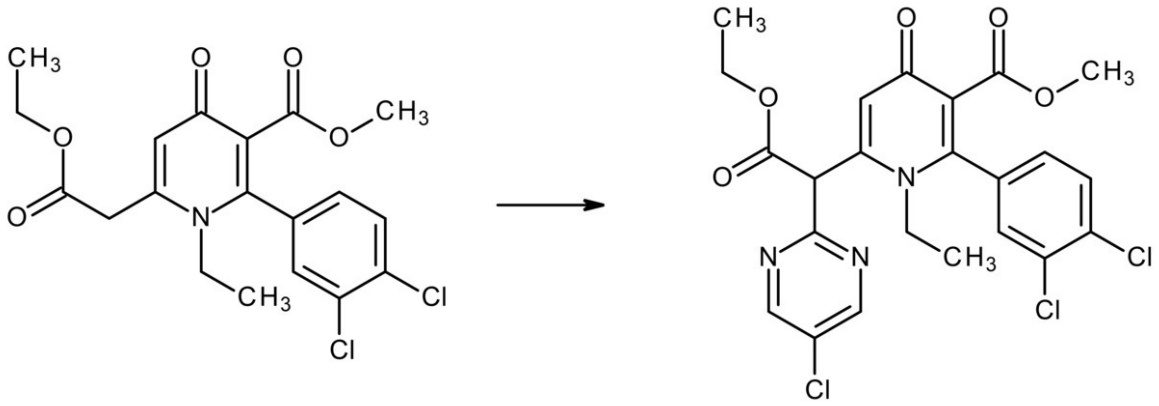


メチル２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレート（１．５０ｇ、４．４０ｍｍｏｌ）のテトラヒドロフラン（２２ｍＬ）中の撹拌溶液に、－３０℃で、ビス（２，２，６，６－テトラメチル－１－ピペリジル）亜鉛．塩化マグネシウム．塩化リチウム（１９．０ｍＬ、６．６０ｍｍｏｌ）を滴下した。０．２５時間後、クロロギ酸エチル（０．６３０ｇ、６．６０ｍｍｏｌ）を赤色の溶液に添加した。反応混合物を０．７５時間撹拌したところ、その後、色が黄色に変色した。水及び酢酸エチルを反応混合物に添加し、これを室温に温めた。有機溶液を水性相から傾瀉し、水性相を酢酸エチルに抽出した。組み合わせた有機抽出物を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、ジクロロメタン中の０～１０％メタノールの勾配を溶離液として用いる、シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、メチル２－（３，４－ジクロロフェニル）－６－（２－エトキシ－２－オキソ－エチル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートを黄色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．５７（ｄ，１Ｈ）７．５２（ｄ，１Ｈ）７．２４－７．３２（ｍ，１Ｈ）６．４５（ｓ，１Ｈ）４．２３（ｑ，２Ｈ）３．７６（ｑ，２Ｈ）３．６６（ｓ，２Ｈ）３．５６（ｓ，３Ｈ）１．３１（ｔ，３Ｈ）１．１１（ｔ，３Ｈ）

【０１７５】

ステップ３：メチル６－［１－（５－クロロピリミジン－２－イル）－２－エトキシ－２－オキソ－エチル］－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートの合成

【化２７】

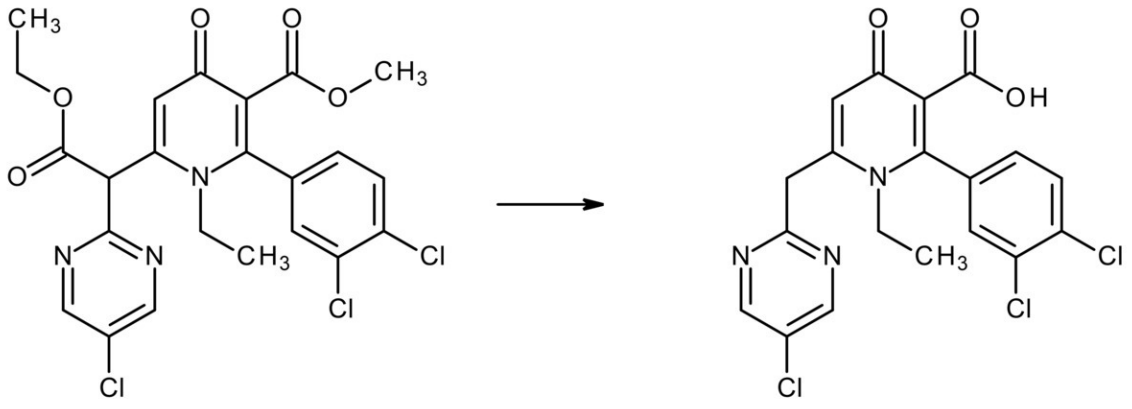


メチル２－（３，４－ジクロロフェニル）－６－（２－エトキシ－２－オキソ－エチル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレート（０．１００ｇ、０．２４３ｍｍｏｌ）、２，５－ジクロロピリミジン（０．０７２ｇ、０．４８５ｍｍｏｌ）及びリン酸三カリウム（０．１３１ｇ、０．６０６ｍｍｏｌ）のメチルスルフィニルメタン（２．１ｍＬ）中の溶液を９０℃に２時間加熱した。反応混合物を室温に冷却し、綿ウールのプラグを通してろ過した。この溶液を、水（＋０．１％ギ酸）中の２０～８５％アセトニトリル（＋０．１％ギ酸）の勾配を溶離液として用いる、Ｃ－１８シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、メチル６－［１－（５－クロロピリミジン－２－イル）－２－エトキシ－２－オキソ－エチル］－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートを得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝８．７１（ｄ，２Ｈ），７．６０－７．４７（ｍ，２Ｈ），７．３１－７．２１（ｍ，１Ｈ），６．４７（ｄ，１Ｈ），５．４２（ｓ，１Ｈ），４．３９－４．２３（ｍ，２Ｈ），３．９０－３．６８（ｍ，２Ｈ），３．５５（ｓ，３Ｈ），１．３０（ｍ，３Ｈ），１．２２（ｔ，３Ｈ）

【０１７６】

ステップ３：６－［（５－クロロピリミジン－２－イル）メチル］－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸の合成

【化２８】



メチル６－［１－（５－クロロピリミジン－２－イル）－２－エトキシ－２－オキソ－エチル］－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレート（０．０７８ｇ、０．１４９ｍｍｏｌ）のメタノール（１．４９ｍＬ）及び水（１．４９ｍＬ）の混合物中の溶液に、水酸化リチウム（０．０６２ｇ、１．４９ｍｍｏｌ）を添加した。得られた溶液を還流で１８時間加熱した。冷却した反応混合物をジクロロメタン及び水で希釈し、２Ｍ水性塩酸の添加によりｐＨ１に酸性化し、その後、ジクロロメタンに抽出した。有機抽出物を減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を

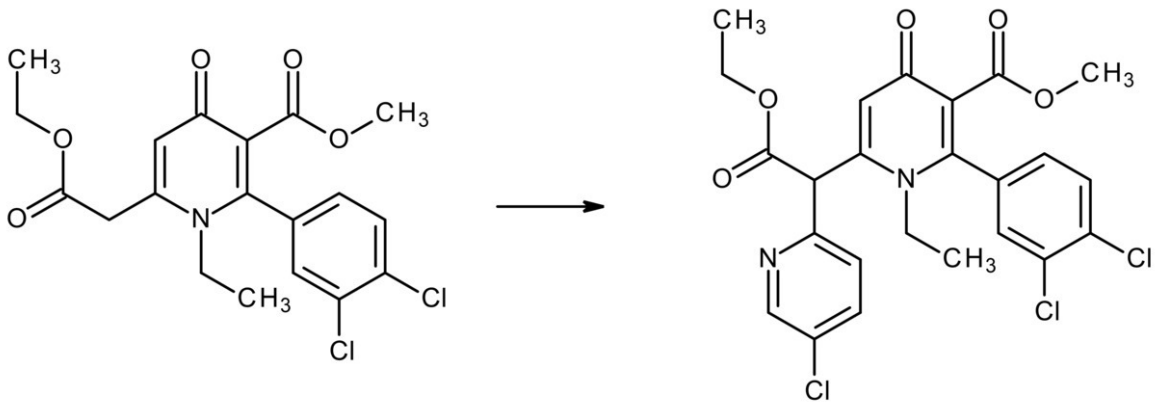
、水（＋０．１％ギ酸）中の２０～１００％アセトニトリル（＋０．１％ギ酸）の勾配を溶離液として用いる、Ｃ－１８シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、６－［（５－クロロピリミジン－２－イル）メチル］－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝８．６９（ｓ，２Ｈ）７．５９（ｄ，１Ｈ）７．３６（ｄ，１Ｈ）７．１０－７．１５（ｍ，１Ｈ）６．８１（ｓ，１Ｈ）４．４２（ｓ，２Ｈ）３．９６（ｑ，２Ｈ）１．２１（ｔ，３Ｈ）

【０１７７】

実施例５：６－［（５－クロロ－２－ピリジル）メチル］－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸（化合物５）の合成

ステップ１：メチル６－［１－（５－クロロ－２－ピリジル）－２－エトキシ－２－オキソ－エチル］－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートの合成

【化２９】

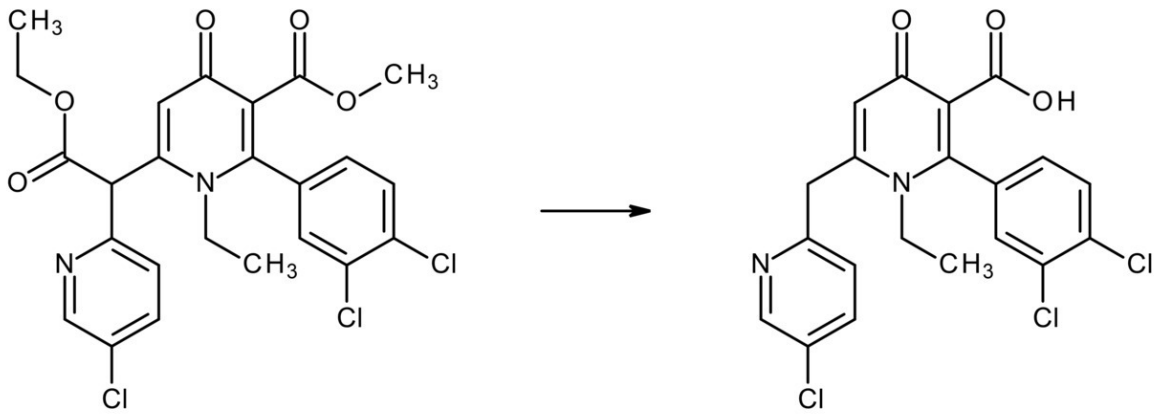


メチル２－（３，４－ジクロロフェニル）－６－（２－エトキシ－２－オキソ－エチル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレート（０．２００ｇ、０．４８５ｍｍｏｌ）、５－クロロ－２－フルオロ－ピリジン（０．１２８ｇ、０．９７０ｍｍｏｌ）及びリン酸三カリウム（０．２６３ｇ、１．２１ｍｍｏｌ）のメチルスルフィニルメタン（２．９ｍＬ）中の溶液を９０℃に４８時間加熱した。反応混合物を室温に冷却し、綿ウールのプラグを通してろ過した。溶液を、水（＋０．１％ギ酸）中の２０～１００％アセトニトリル（＋０．１％ギ酸）の勾配を溶離液として用いる、Ｃ－１８シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、メチル６－［１－（５－クロロ－２－ピリジル）－２－エトキシ－２－オキソ－エチル］－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートを得た。１Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝８．５１（ｔ，１Ｈ），７．７６（ｍ，１Ｈ），７．６０－７．４５（ｍ，３Ｈ），７．３０－７．２６（ｍ，１Ｈ），６．５８（ｄ，１Ｈ），５．２８（ｓ，１Ｈ），４．３６－４．２４（ｍ，２Ｈ），３．９５（ｍ，１Ｈ），３．６９（ｍ，１Ｈ），３．５５（ｄ，３Ｈ），１．３１（ｍ，３Ｈ），１．２１－１．１３（ｍ，３Ｈ）

【０１７８】

ステップ２：６－［（５－クロロ－２－ピリジル）メチル］－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸の合成

【化３０】

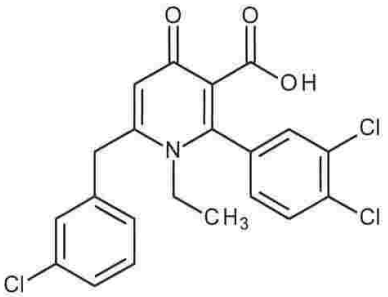
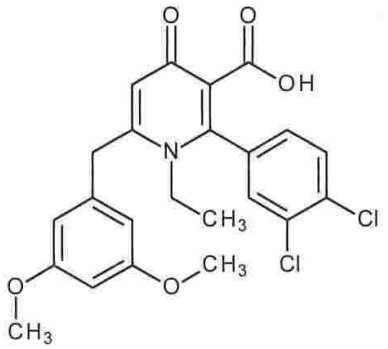
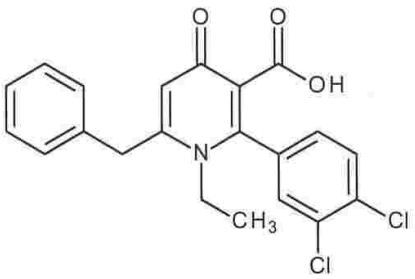


メチル６－［１－（５－クロロ－２－ピリジル）－２－エトキシ－２－オキソ－エチル］－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレート（０．１００ｇ、０．１９１ｍｍｏｌ）のメタノール（１．９１ｍＬ）及び水（１．９１ｍＬ）中の溶液に、リチウム；水酸化物；水和物（０．０８０ｇ、１．９１ｍｍｏｌ）を添加した。得られた溶液を７０℃で２時間加熱した。冷却した反応混合物に、水及び酢酸エチルを添加した。相を分離し、水性相を２Ｍ水性塩酸を用いてｐＨ１に酸性化し、その後、酢酸エチルに抽出した。有機抽出物を減圧下で乾燥するまで蒸発させて、６－［（５－クロロ－２－ピリジル）メチル］－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝８．５１（ｄ，１Ｈ）７．７１（ｄｄ，１Ｈ）７．５８（ｄ，１Ｈ）７．３９（ｄ，１Ｈ）７．２４－７．３０（ｍ，１Ｈ）７．１５（ｄｄ，１Ｈ）６．６３（ｓ，１Ｈ）４．２６（ｓ，２Ｈ）３．９１－４．０３（ｍ，２Ｈ）１．２０（ｔ，３Ｈ）

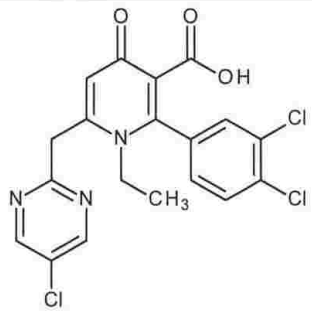
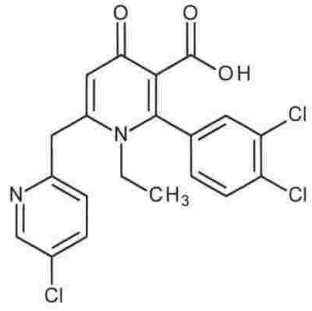
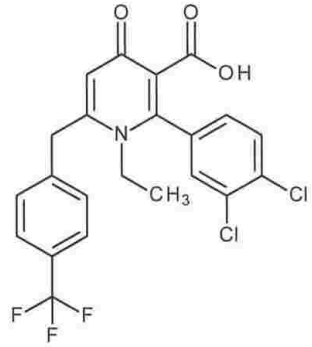
【０１７９】

【表５－１】

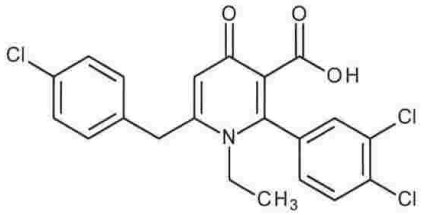
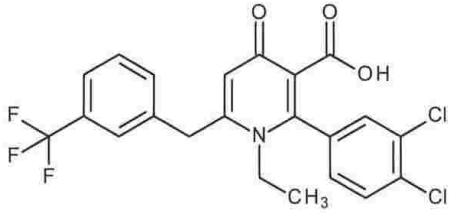
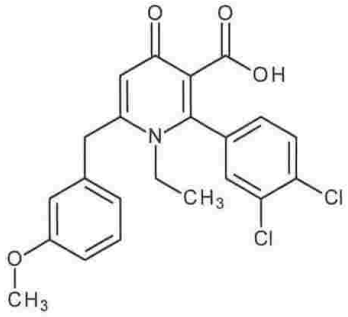
表 2:本発明の選択された化合物の ^{1}H NMR データ。

化合物 No.	化合物名	構造& ^{1}H NMR データ
1	6-[(3-クロロフェニル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.57 (d, 1H), 7.37 – 7.31 (m, 3H), 7.18 (s, 1H), 7.12 (dd, 1H), 7.07 (brd, 1H), 6.58 (s, 1H), 4.08 (s, 2H), 3.79 (q, 2H), 1.22 – 1.13 (m, 3H)
2	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[(3,5-ジメトキシフェニル)メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.57 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 6.66 (s, 1H), 6.42 (t, 1H), 6.29 (d, 2H), 4.02 (s, 2H), 3.85 – 3.80 (m, 2H), 3.78 (s, 6H), 1.18 (t, 3H)
3	6-ベンジル-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	

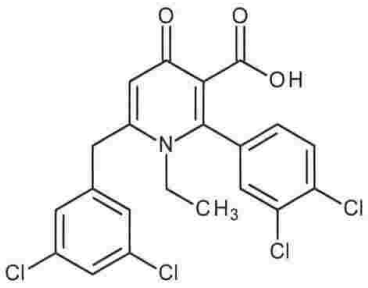
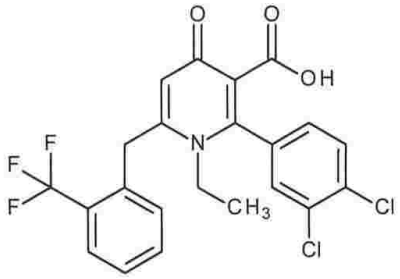
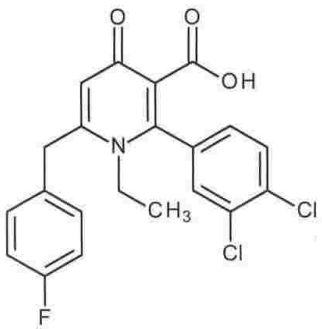
【表５－２】

		^{1}H NMR (400MHz, クロロホルム-d) δ = 7.57 (d, 1H), 7.44 – 7.31 (m, 4H), 7.23 – 7.09 (m, 3H), 6.66 (s, 1H), 4.11 (s, 2H), 3.81 (q, 2H), 1.17 (t, 3H)
4	6-[(5-クロロピリミジン-2-イル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ = 8.69 (s, 2H), 7.59 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.15 – 7.10 (m, 1H), 6.81 (s, 1H), 4.42 (s, 2H), 3.96 (q, 2H), 1.21 (t, 3H)
5	6-[(5-クロロ-2-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ = 8.51 (d, 1H), 7.71 (dd, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.30 – 7.24 (m, 1H), 7.15 (dd, 1H), 6.63 (s, 1H), 4.26 (s, 2H), 4.03 – 3.91 (m, 2H), 1.20 (t, 3H)
6	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-[[4-(トリフルオロメチル)フェニル]メチル]ピリジン-3-カルボン酸	

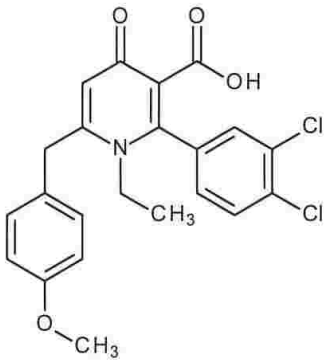
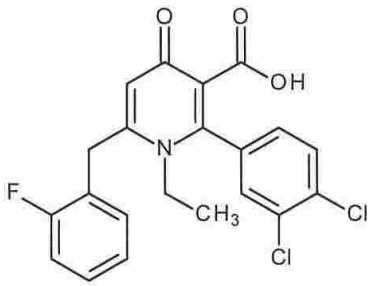
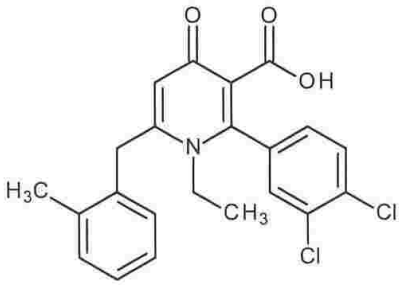
【表５－３】

		^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.82 (d, 1H), 7.80 - 7.74 (m, 3H), 7.59 - 7.52 (m, 2H), 7.48 - 7.40 (m, 1H), 6.66 (s, 1H), 4.40 (s, 2H), 3.86 - 3.70 (m, 2H), 1.10 - 0.99 (m, 3H)
7	6-[(4-クロロフェニル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.57 (d, 1H), 7.39 - 7.34 (m, 3H), 7.15 - 7.09 (m, 3H), 6.60 (s, 1H), 4.08 (s, 2H), 3.80 (q, 2H), 1.18 (t, 3H)
8	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-[[3-(トリフルオロメチル)フェニル]メチル]ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.67 - 7.63 (m, 1H), 7.60 - 7.53 (m, 2H), 7.46 (s, 1H), 7.39 (brd, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.12 (dd, 1H), 6.57 (s, 1H), 4.18 (s, 2H), 3.82 (q, 2H), 1.20 (t, 3H)
9	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(3-メトキシフェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.57 (d, 1H), 7.34 (d, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.10 (dd, 1H), 6.88 (dd, 1H), 6.74 (d, 1H), 6.71 - 6.67 (m, 2H), 4.07 (s, 2H), 3.83 - 3.77 (m, 5H), 1.17 (t, 3H)

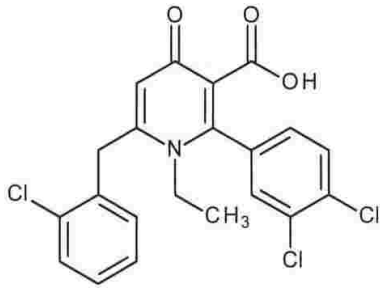
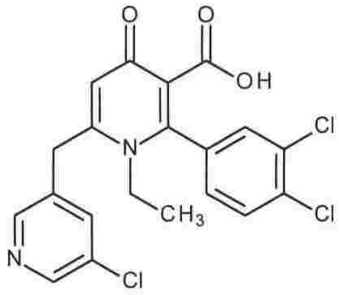
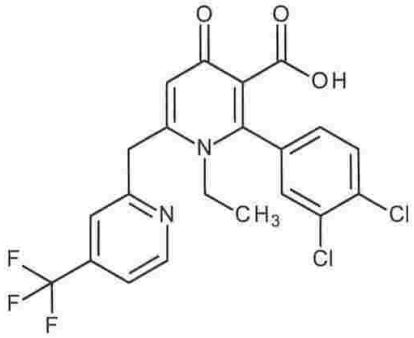
【表５－４】

10	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[(3,5-ジクロロフェニル)メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.58 (d, 1H), 7.37 (d, 2H), 7.14 (dd, 1H), 7.09 (d, 2H), 6.55 (s, 1H), 4.05 (s, 2H), 3.79 (q, 2H), 1.20 (t, 3H)
11	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-[[2-(トリフルオロメチル)フェニル]メチル]ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.79 (d, 1H), 7.65 – 7.56 (m, 2H), 7.55 – 7.50 (m, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 6.38 (s, 1H), 4.28 (s, 2H), 3.90 – 3.71 (m, 2H), 1.22 (t, 3H)
12	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(4-フルオロフェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.80 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.43 (dd, 1H), 7.36 (dd, 2H), 7.30 – 7.20 (m, 2H), 6.63 – 6.54 (m, 1H), 4.27 (s, 2H), 3.78 (q, 2H), 1.03 (t, 3H)

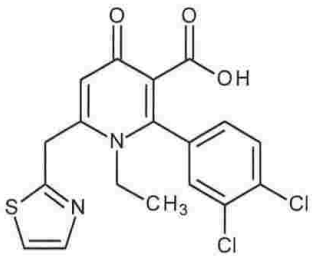
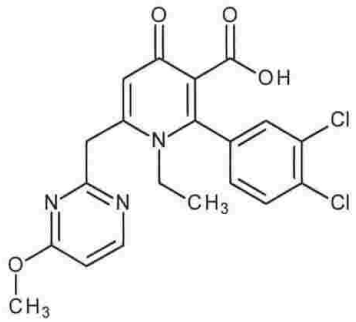
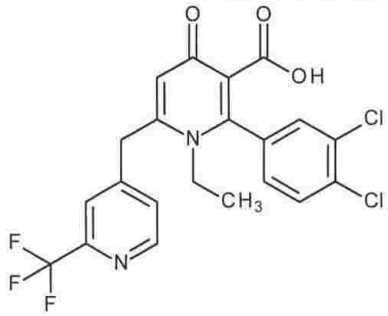
【表５－５】

13	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(4-メトキシフェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.55 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.13 – 7.07 (m, 3H), 6.93 – 6.88 (m, 2H), 6.60 – 6.55 (m, 1H), 4.04 (s, 2H), 3.85 – 3.80 (m, 5H), 1.16 (t, 3H)
14	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(2-フルオロフェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.58 (d, 1H), 7.40 – 7.35 (m, 2H), 7.21 – 7.12 (m, 4H), 6.50 (s, 1H), 4.12 (s, 2H), 3.88 (q, 2H), 1.23 (t, 3H)
15	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-(o-トリルメチル)-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.58 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.31 – 7.20 (m, 3H), 7.14 (dd, 1H), 7.01 (d, 1H), 6.39 (s, 1H), 4.05 (s, 2H), 3.85 (q, 2H), 2.28 (s, 3H), 1.25 (t, 3H)

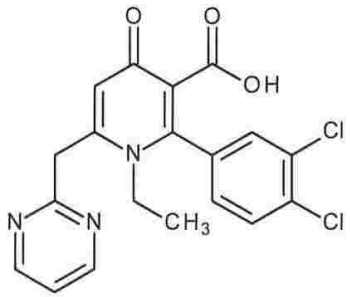
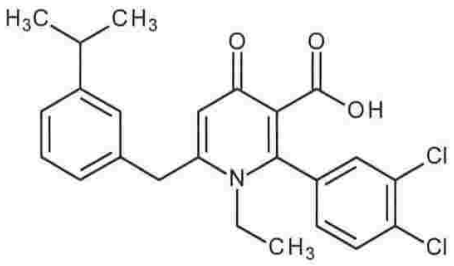
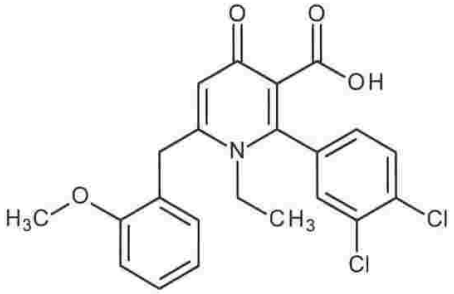
【表５－６】

16	6-[(2-クロロフェニル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.59 (d, 1H), 7.51 – 7.46 (m, 1H), 7.40 – 7.29 (m, 3H), 7.25 – 7.20 (m, 1H), 7.15 (dd, 1H), 6.36 (s, 1H), 4.20 (s, 2H), 3.87 (q, 2H), 1.27 (t, 3H)
17	6-[(5-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.60 (d, 1H), 8.39 (d, 1H), 7.61 – 7.56 (m, 2H), 7.38 (d, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.53 (s, 1H), 4.12 (s, 2H), 3.82 (q, 2H), 1.23 (t, 3H)
18	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-[[4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]メチル]ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.75 (d, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.54 – 7.50 (m, 2H), 7.39 (d, 1H), 7.16 (dd, 1H), 6.64 (s, 1H), 4.36 (s, 2H), 4.08 – 3.91 (m, 2H), 1.21 (t, 3H)

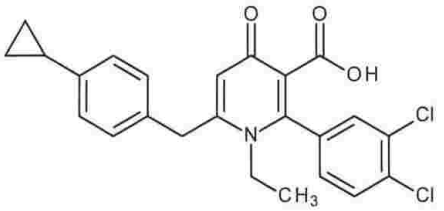
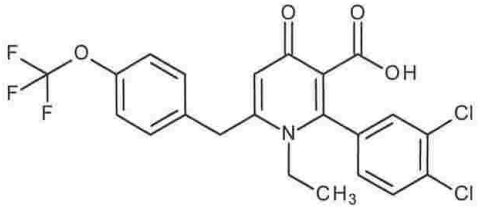
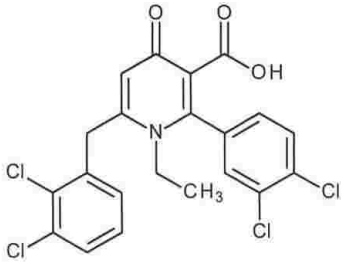
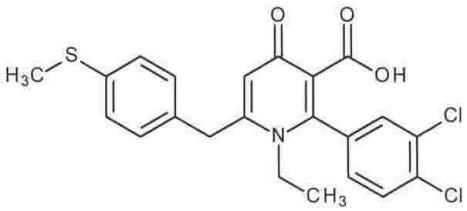
【表５－７】

19	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-(チアゾール-2-イルメチル)ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.77 (d, 1H), 7.62 – 7.57 (m, 1H), 7.41 – 7.36 (m, 2H), 7.14 (dd, 1H), 6.81 (s, 1H), 4.49 (s, 2H), 4.12 (q, 2H), 1.19 (t, 3H)
20	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(4-メトキシピリミジン-2-イル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.37 (d, 1H), 7.59 (d,1H), 7.36 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.69 (d, 1H), 4.32 (s, 2H), 4.04 – 3.98 (m, 2H), 3.95 (s, 3H), 1.21 (t, 3H)
21	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-[[2-(トリフルオロメチル)-4-ピリジル]メチル]ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.80 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.56 (s, 1H), 7.37 – 7.32 (m, 2H), 7.12 (dd, 1H), 6.58 (s, 1H), 4.21 (s, 2H), 3.77 (q, 2H), 1.22 (t, 3H)

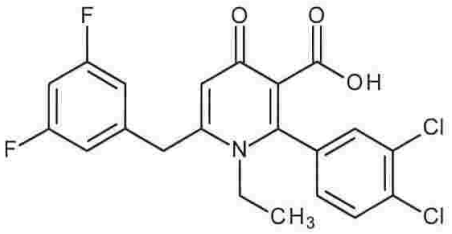
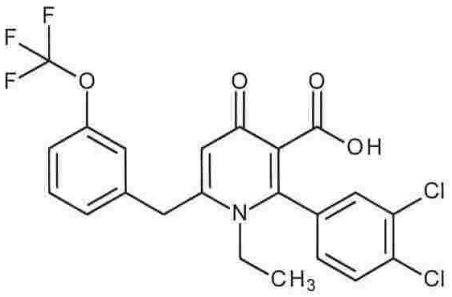
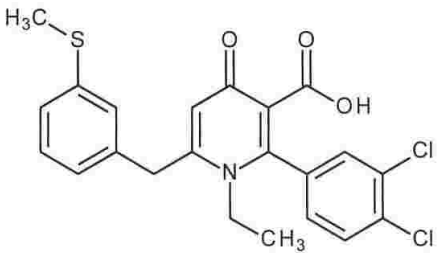
【表５－８】

22	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-(ピリミジン-2-イルメチル)ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.74 (d, 2H), 7.59 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.31 (t, 1H), 7.15 (dd, 1H), 6.84 (s, 1H), 4.45 (s, 2H), 3.99 (q, 2H), 1.20 (t, 3H)
23	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(3-イソプロピルフェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.70 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.36 - 7.33 (m, 1H), 7.33 - 7.28 (m, 1H), 7.24 - 7.17 (m, 1H), 7.16 (s, 1H), 7.06 (d, 1H), 6.24 (s, 1H), 4.13 (s, 2H), 3.71 (q, 2H), 2.92 - 2.87 (m, 1H), 1.21 - 1.20 (m, 6H), 0.94 (t, 3H)
24	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(2-メトキシフェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.79 - 7.70 (m, 2H), 7.41 (d, 1H), 7.36 (t, 1H), 7.19 (brd, 1H), 7.10 (d, 1H), 7.00 (t, 1H), 6.17 (brs, 1H), 4.10 (s, 2H), 3.80 (s, 5H), 1.08 (brt, 3H)

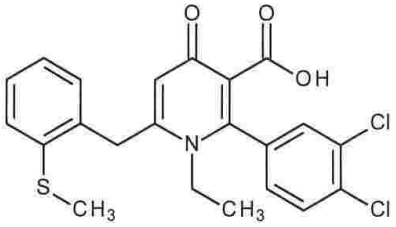
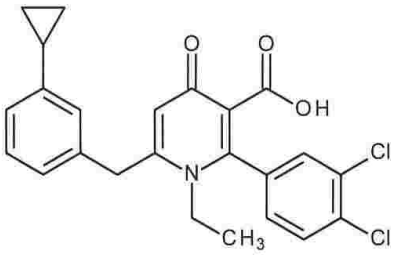
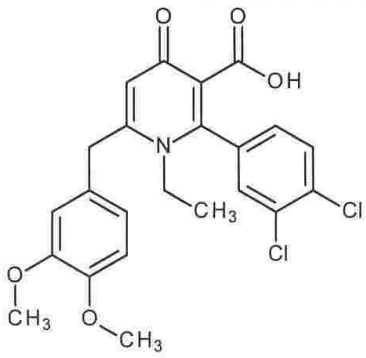
【表５－９】

25	6-[(4-シクロプロピルフェニル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.68 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.32 (dd, 1H), 7.16 - 7.12 (m, 2H), 7.11 - 7.06 (m, 2H), 6.20 (s, 1H), 4.07 (s, 2H), 3.68 (q,2H), 1.94 - 1.87 (m, 1H), 0.98 - 0.90 (m, 5H), 0.71 - 0.61 (m, 2H)
26	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-[[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.71 - 7.61 (m, 2H), 7.45 - 7.32 (m, 5H), 6.16 (s, 1H), 4.17 (s, 2H), 3.68 (q, 2H), 0.92 (t, 3H)
27	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[(2,3-ジクロロフェニル)メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.76 - 7.70 (m, 2H), 7.68 (dd, 1H), 7.45 (t, 1H), 7.40 (dd, 1H), 7.37 (dd, 1H), 5.88 (s, 1H), 4.31 (s, 2H), 3.76 (q, 2H), 1.09 (t, 3H)
28	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(4-メチルスルファニルフェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	

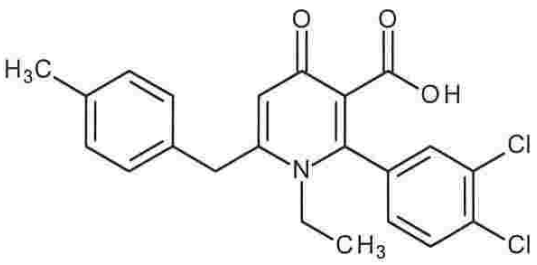
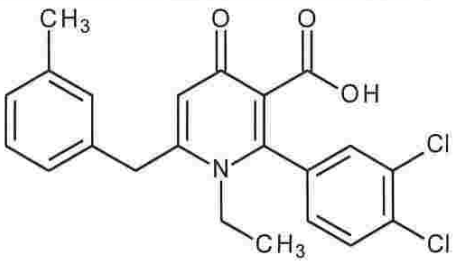
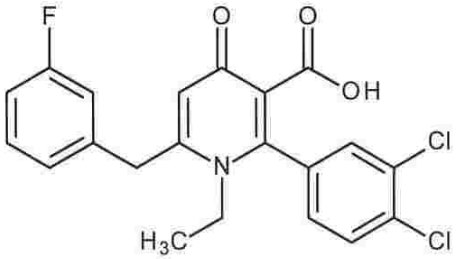
【表５－１０】

		^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = δ 7.70 (d, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.35 (dd, 1H), 7.29 (d, 2H), 7.23 (d, 2H), 6.28 (s, 1H), 4.13 (s, 2H), 3.71 (q, 2H), 2.48 (s, 3H), 0.96 (t, 3H)
29	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[(3,5-ジフルオロフェニル)メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.76 - 7.71 (m, 2H), 7.41 - 7.39 (m, 1H), 7.20 (t, 1H), 7.11 - 7.06 (m, 2H), 6.47 (s, 1H), 4.26 (s, 2H), 3.72 (q, 2H), 0.99 (t, 3H)
30	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-[[3-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.69 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.54 (t, 1H), 7.37 - 7.30 (m, 4H), 6.22 (s, 1H), 4.24 (s, 2H), 3.70 (q, 2H), 0.93 (t, 3H)
31	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(3-メチルスルファニルフェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.71 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.37 - 7.33 (m, 2H), 7.22 - 7.20 (m, 2H), 7.04 (d, 1H), 6.33 (s, 1H), 4.17 (s, 2H), 3.74 (q, 2H), 2.48 (s, 3H), 0.98 (t, 3H)

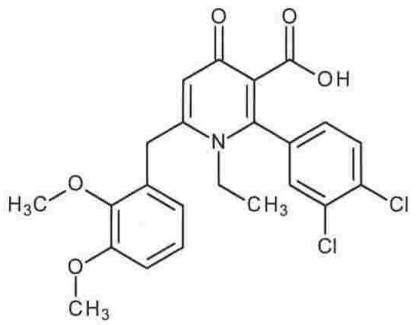
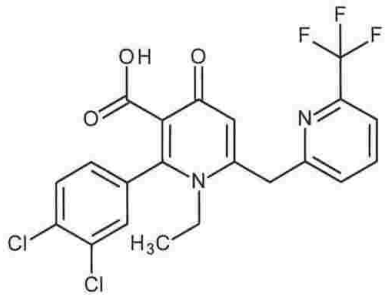
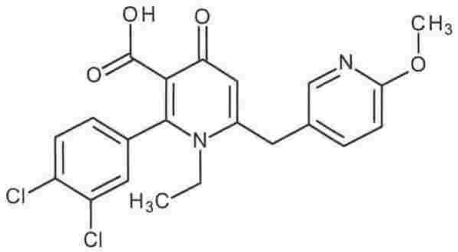
【表５－１１】

32	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(2-メチルスルファニルフェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.70 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.41 - 7.37 (m, 2H), 7.35 (dd, 1H), 7.26 - 7.22 (m, 1H), 7.20 - 7.19 (m, 1H), 5.79 (s, 1H), 4.12 (s, 2H), 3.73 (q, 2H), 2.49 (s, 3H), 1.07 (t, 3H)
33	6-[(3-シクロプロピルフェニル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.78 - 7.72 (m, 2H), 7.39 (dd, 1H), 7.26 (t, 1H), 7.05 - 6.99 (m, 3H), 6.45 (s, 1H), 4.18 (s, 2H), 3.76 (q, 2H), 1.95 - 1.90 (m, 1H), 1.01 (t, 3H), 0.98 - 0.93 (m, 2H), 0.68 - 0.65 (m, 2H)
34	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[(3,4-ジメトキシフェニル)メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.71 (d, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.36 (dd, 1H), 6.96 (d, 1H), 6.93 (d, 1H), 6.78 (dd, 1H), 6.29 (s, 1H), 4.11 (s, 2H), 3.83 - 3.72 (m, 8H), 0.99 (t, 3H)

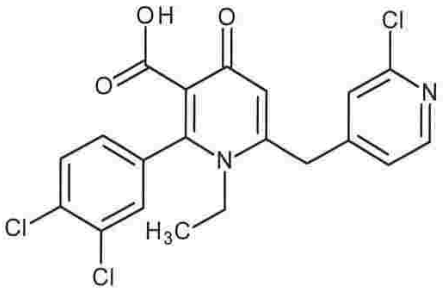
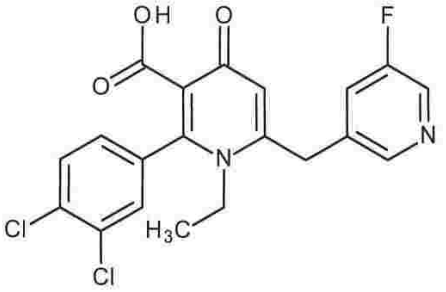
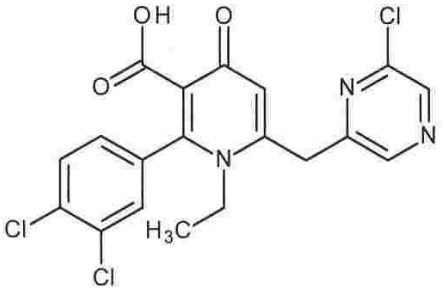
【表５－１２】

35	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-(p-トリルメチル)ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.69 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.34 (dd, 1H), 7.20 (d, 2H), 7.16 (d, 2H), 6.25 (s, 1H), 4.10 (s, 2H), 3.69 (q, 2H), 2.30 (s, 3H), 0.95 (t, 3H)
36	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-(m-トリルメチル)-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.70 (d, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.36 (dd, 1H), 7.30 - 7.27 (m, 1H), 7.13 - 7.10 (m, 2H), 7.07 (d, 1H), 6.33 (s, 1H), 4.14 (s, 2H), 3.73 (q, 2H), 2.32 (s, 3H), 0.97 (t, 3H)
37	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(3-フルオロフェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.76 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.50 - 7.42 (m, 1H), 7.40 (dd, 1H), 7.21 - 7.11 (m, 3H), 6.50 (s, 1H), 4.26 (s, 2H), 3.79 - 3.69 (m, 2H), 1.00 (t, 3H)

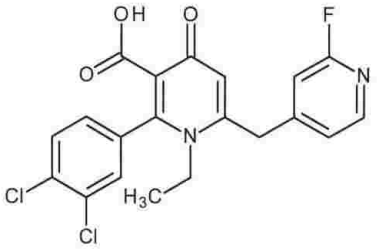
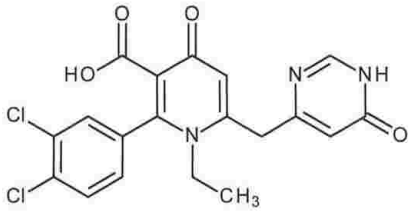
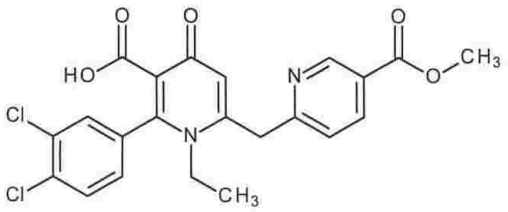
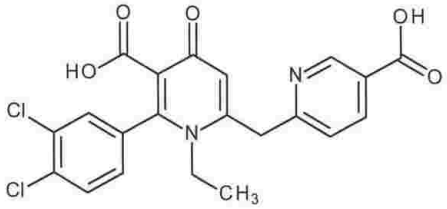
【表５－１３】

38	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[(2,3-ジメトキシフェニル)メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.15 - 7.05 (m, 2H), 6.84 - 6.78 (m, 1H), 6.37 (s, 1H), 4.19 (s, 2H), 3.88 - 3.83 (m, 5H), 3.72 (s, 3H), 1.12 (t, 3H)
39	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-[[6-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]メチル]ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.97 - 7.91 (m, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.57 - 7.54 (m, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.17 (dd, 1H), 6.65 (s, 1H), 4.37 (s, 2H), 4.03 (q, 2H), 1.20 (t, 3H)
40	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(6-メトキシ-3-ピリジル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 8.01 (d, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.41 (dd, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.12 (dd, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.57 (s, 1H), 4.02 (s, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.84 (q, 2H), 1.24 - 1.19 (m, 3H)

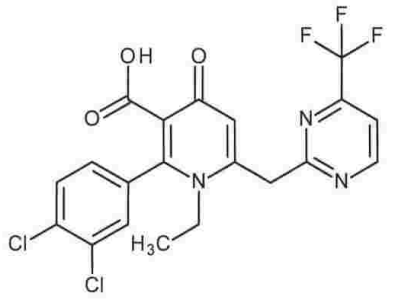
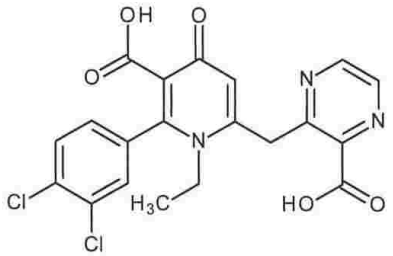
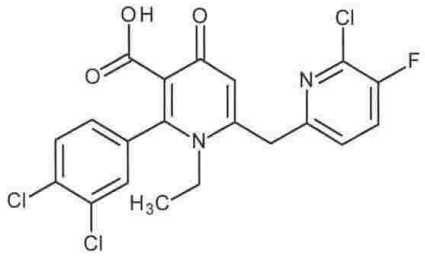
【表５－１４】

41	6-[(2-クロロ-4-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.46 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.14 - 7.06 (m, 2H), 6.65 (s, 1H), 4.10 (s, 2H), 3.75 (br d, 2H), 1.24 - 1.17 (t, 3H)
42	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(5-フルオロ-3-ピリジル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, DMSO-d6) δ = 8.57 (d, 1H), 8.48 (s, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.79 - 7.76 (m, 1H), 7.75 - 7.70 (m, 1H), 7.46 (dd, 1H), 6.68 (s, 1H), 4.38 (s, 2H), 3.88 - 3.70 (m, 2H), 1.06 (t, 3H)
43	6-[(6-クロロピラジン-2-イル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.62 (s, 1H), 8.52 (s, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 6.66 (s, 1H), 4.28 (s, 2H), 3.98 (q, 2H), 1.23 (t, 3H)

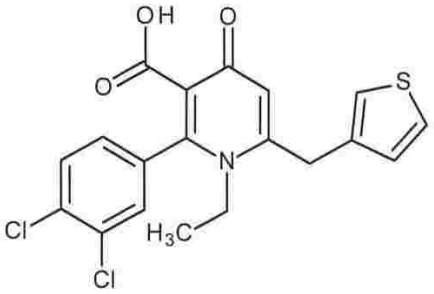
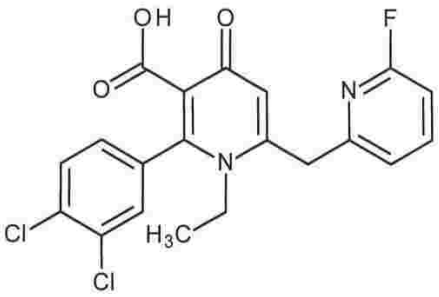
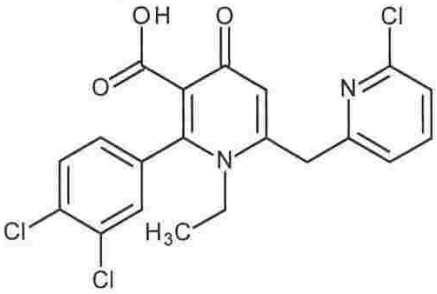
【表５－１５】

44	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(2-フルオロ-4-ピリジル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.29 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.12 (br d, 1H), 7.05 (br d, 1H), 6.80 (s, 1H), 6.64 (s, 1H), 4.15 (s, 2H), 3.81 - 3.70 (m, 2H), 1.21 (t, 3H)
45	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-[(6-オキソ-1H-ピリミジン-4-イル)メチル]ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 12.60 (br s, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.43 (dd, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.43 (s, 1H), 4.13 (s, 2H), 3.85 (q, 2H), 1.06 (t, 3H)
46	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(5-メトキシカルボニル-2-ピリジル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 9.07 - 9.04 (m, 1H), 8.33 (dd, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.42 (dd, 1H), 6.82 (s, 1H), 4.55 (s, 2H), 3.89 (s, 3H), 3.84 (q, 2H), 1.00 (t, 3H)
47	6-[(5-カルボキシ-2-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	

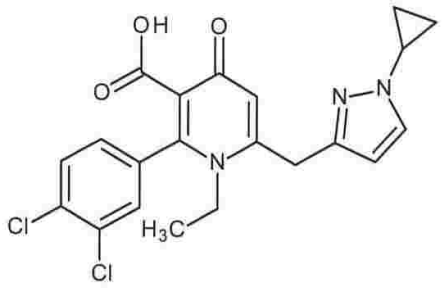
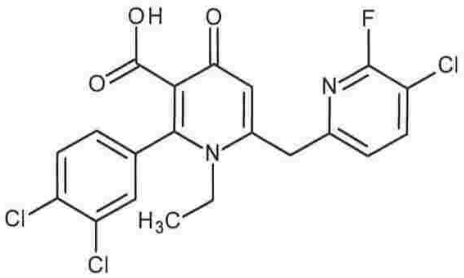
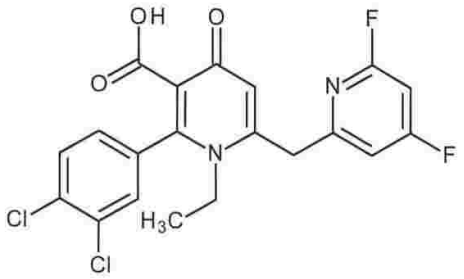
【表５－１６】

		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 9.03 (d, 1H), 8.30 (dd, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.42 (dd, 1H), 6.83 (s, 1H), 4.54 (s, 2H), 3.85 (q, 2H), 1.01 (t, 3H)
48	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-[[4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-2-イル]メチル]ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 9.21 (d, 1H), 8.02 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.40 (dd, 1H), 6.87 (s, 1H), 4.73 (s, 2H), 3.84 (q, 2H), 1.03 (t, 3H)
49	3-[[5-カルボキシ-6-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-2-ピリジル]メチル]ピラジン-2-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.81 (d, 1H), 8.75 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.42 (dd, 1H), 6.49 (s, 1H), 4.80 (s, 2H), 3.82 (q, 2H), 1.08 (t, 3H)
50	6-[(6-クロロ-5-フルオロ-2-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.62 - 7.51 (m, 2H), 7.38 (d, 1H), 7.27 - 7.24 (m, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.62 (s, 1H), 4.23 (s, 2H), 3.98 (q, 2H), 1.21 (t, 3H)

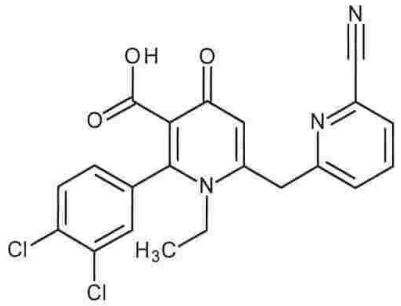
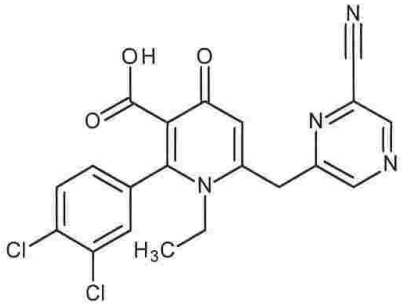
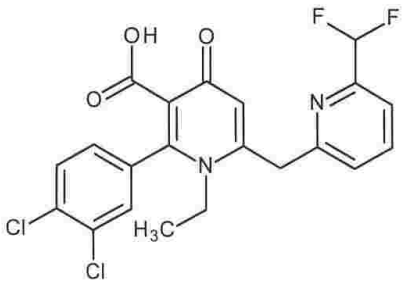
【表５－１７】

51	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-(3-チエニルメチル)ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.58 (d, 1H), 7.41 (dd, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 7.11 – 7.06 (m, 1H), 6.94 (dd, 1H), 6.67 (s, 1H), 4.12 (s, 2H), 3.83 (q, 2H), 1.17 (t, 3H)
52	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(6-フルオロ-2-ピリジル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.89 – 7.81 (m, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.22 – 7.11 (m, 2H), 6.93 (dd, 1H), 6.64 (s, 1H), 4.22 (s, 2H), 3.99 (q, 2H), 1.20 (t, 3H)
53	6-[(6-クロロ-2-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.75 – 7.68 (m, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 6.66 (s, 1H), 4.25 (s, 2H), 3.99 (q, 2H), 1.19 (t, 3H)

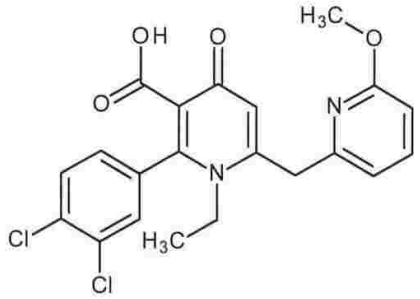
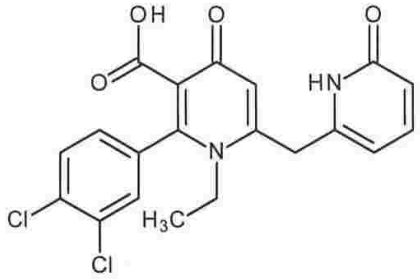
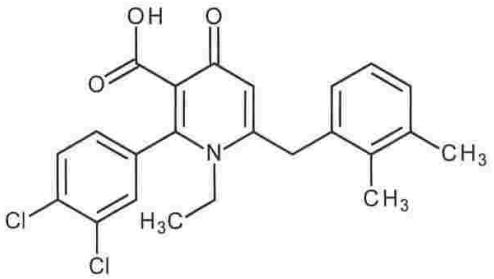
【表５－１８】

54	6-[(1-シクロプロピルピラゾール-3-イル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.57 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.12 (dd, 1H), 6.74 (s, 1H), 6.08 (d, 1H), 4.08 (s, 2H), 3.97 - 3.90 (m, 2H), 3.60 - 3.52 (m, 1H), 1.16 (t, 3H), 1.09 - 1.02 (m, 4H)
55	6-[(5-クロロ-6-フルオロ-2-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.90 - 7.84 (m, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.40 - 7.35 (m, 1H), 7.21 - 7.11 (m, 2H), 6.63 (s, 1H), 4.20 (s, 2H), 3.97 (q, 2H), 1.21 (t, 3H)
56	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[(4,6-ジフルオロ-2-ピリジル)メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.90 - 7.84 (m, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.40 - 7.35 (m, 1H), 7.21 - 7.11 (m, 2H), 6.63 (s, 1H), 4.20 (s, 2H), 3.97 (q, 2H), 1.21 (t, 3H)

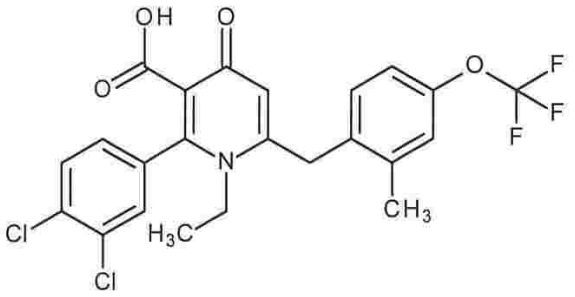
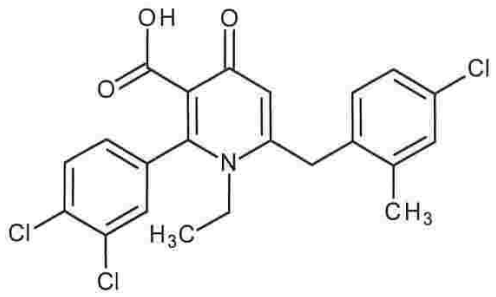
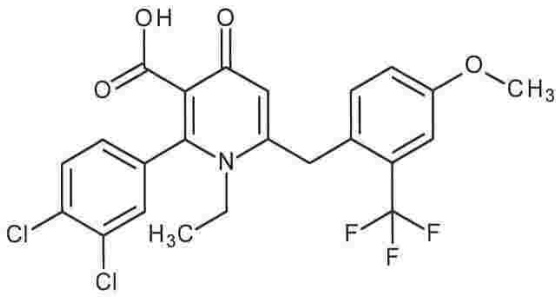
【表５－１９】

57	6-[(6-シアノ-2-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.96 - 7.90 (m, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.65 (s, 1H), 4.32 (s, 2H), 4.01 (q, 2H), 1.22 (t, 3H)
58	6-[(6-シアノピラジン-2-イル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.94 (s, 1H), 8.86 (s, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.64 (s, 1H), 4.38 (s, 2H), 3.98 (d, 2H), 1.26 (t, 3H)
59	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[[6-(ジフルオロメチル)-2-ピリジル]メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.94 - 7.88 (m, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.11 (dd, 1H), 6.71 - 6.69 (m, 1H), 6.58 - 6.39 (m, 1H), 4.32 (s, 2H), 3.99 (q, 2H), 1.18 (t, 3H)

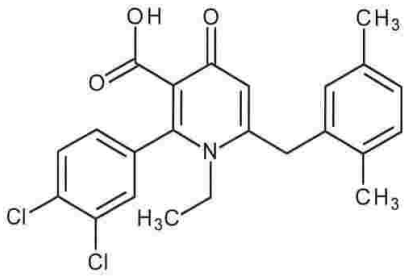
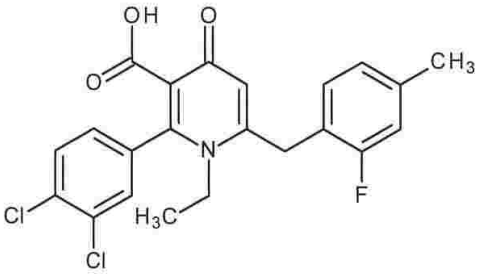
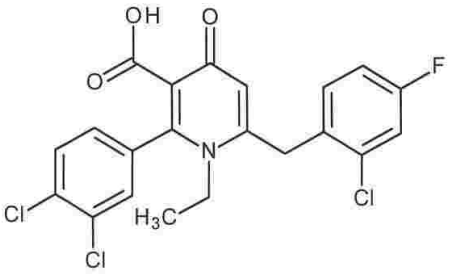
【表５－２０】

60	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(6-メトキシ-2-ピリジル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.62 - 7.57 (m, 2H), 7.33 (d, 1H), 7.10 (dd, 1H), 6.82 (d, 1H), 6.76 (s, 1H), 6.70 (d, 1H), 4.16 (s, 2H), 4.10 - 4.02 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 1.20 (t, 3H)
61	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-[(6-オキソ-1H-ピリジン-2-イル)メチル]ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.82 - 7.76 (m, 2H), 7.48 - 7.38 (m, 2H), 6.63 (s, 1H), 6.32 (br d, 1H), 6.13 (br s, 1H), 4.18 (s, 2H), 3.78 (q, 2H), 1.06 (t, 3H)
62	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[(2,3-ジメチルフェニル)メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.85 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.47 (dd, 1H), 7.19 (d, 1H), 7.16 - 7.12 (m, 1H), 7.00 (d, 1H), 6.12 (s, 1H), 4.23 (s, 2H), 3.86 (q, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.14 (s, 3H), 1.16 (t, 3H)

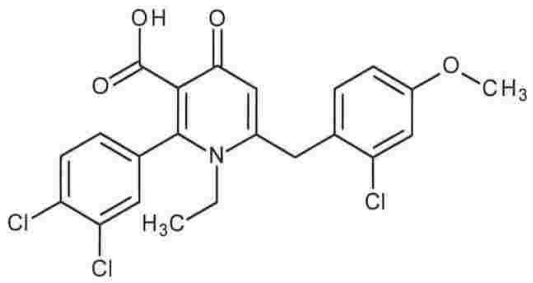
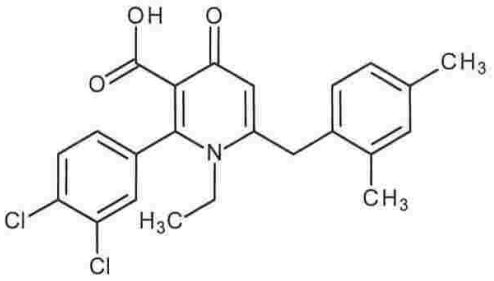
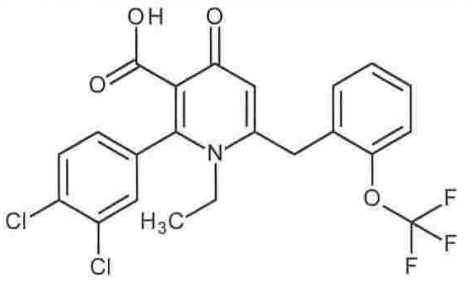
【表５－２１】

63	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[[2-メチル-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.85 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.48 (dd, 1H), 7.34 (s, 1H), 7.27 (d, 1H), 7.23 (br d, 1H), 6.21 (s, 1H), 4.24 (s, 2H), 3.82 (q, 2H), 2.31 (s, 3H), 1.14 (t, 3H)
64	6-[(4-クロロ-2-メチル-フェニル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.84 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.47 (dd, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.30 (dd, 1H), 7.18 (d, 1H), 6.19 (s, 1H), 4.21 (s, 2H), 3.82 (q, 2H), 2.27 (s, 3H), 1.14 (t, 3H)
65	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[[4-メトキシ-2-(トリフルオロメチル)フェニル]メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.84 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.49 - 7.41 (m, 2H), 7.41 - 7.34 (m, 2H), 6.37 (s, 1H), 4.23 (s, 2H), 3.90 (s, 3H), 3.82 (q, 2H), 1.11 (t, 3H)

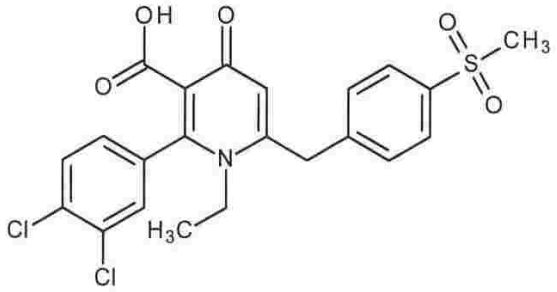
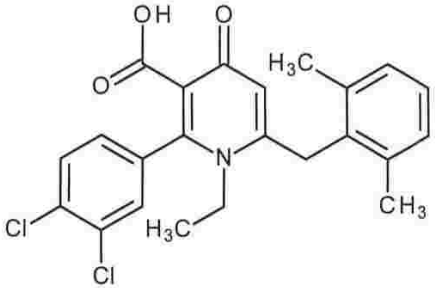
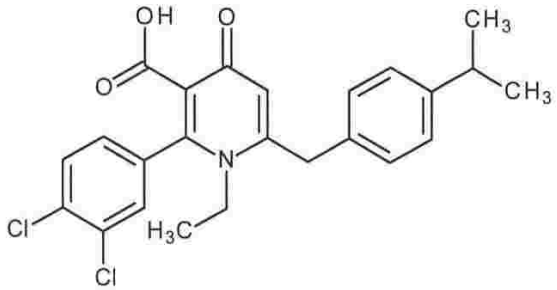
【表５－２２】

66	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[(2,5-ジメチルフェニル)メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.19 (d, 1H), 7.09 (d, 1H), 6.98 (s, 1H), 6.13 (s, 1H), 4.17 (s, 2H), 3.86 (q, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.15 (t, 3H)
67	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(2-フルオロ-4-メチル-フェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.28 - 7.21 (m, 1H), 7.14 (d, 1H), 7.09 (d, 1H), 6.35 (s, 1H), 4.23 (s, 2H), 3.85 (q, 2H), 2.35 (s, 3H), 1.10 (t, 3H)
68	6-[(2-クロロ-4-フルオロ-フェニル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.84 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.61 (dd, 1H), 7.50 - 7.44 (m, 2H), 7.36 - 7.29 (m, 1H), 6.16 (s, 1H), 4.33 (s, 2H), 3.85 (q, 2H), 1.15 (t, 3H)

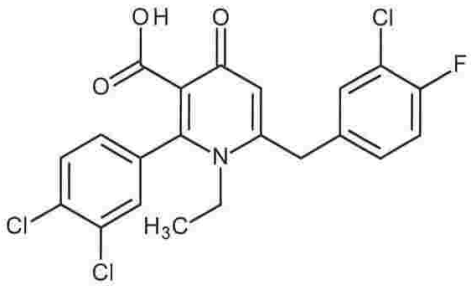
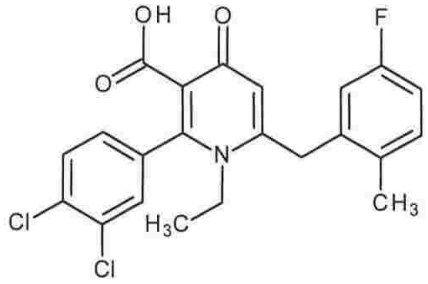
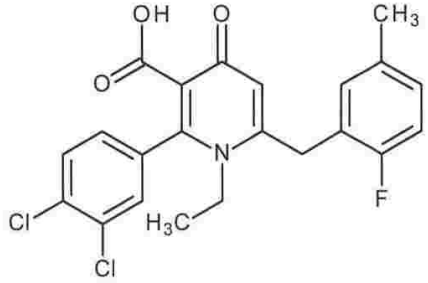
【表５－２３】

69	6-[(2-クロロ-4-メトキシ-フェニル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.19 (d, 1H), 7.02 (dd, 1H), 6.14 (s, 1H), 4.26 (s, 2H), 3.87 (q, 2H), 3.82 (s, 3H), 1.15 (t, 3H)
70	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[(2,4-ジメチルフェニル)メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.84 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.12 (s, 1H), 7.07 - 7.05 (m, 1H), 7.04 - 7.02 (m, 1H), 6.16 (s, 1H), 4.16 (s, 2H), 3.84 (q, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 1.14 (t, 3H)
71	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-[[2-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メチル]ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.82 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.56 - 7.41 (m, 5H), 6.36 (s, 1H), 4.30 (s, 2H), 3.80 (q, 2H), 1.08 (t, 3H)

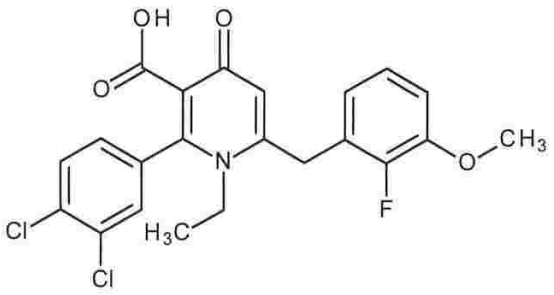
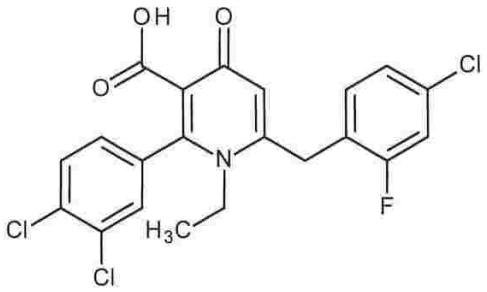
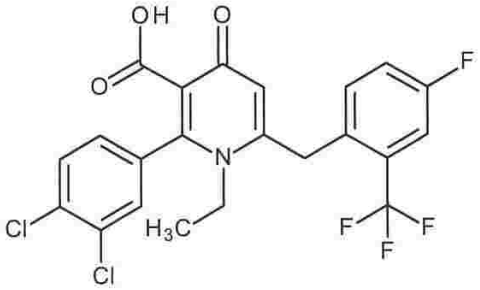
【表５－２４】

72	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(4-メチルスルホニルフェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.95 (d, 2H), 7.82 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.59 (d, 2H), 7.44 (dd, 1H), 6.65 (s, 1H), 4.42 (s, 2H), 3.76 (q, 2H), 3.24 (s, 3H), 1.05 (t, 3H)
73	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[(2,6-ジメチルフェニル)メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.85 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.49 (dd, 1H), 7.24 - 7.20 (m, 1H), 7.20 - 7.17 (m, 2H), 5.70 (s, 1H), 4.18 (s, 2H), 4.02 (q, 2H), 2.24 (s, 6H), 1.22 (t, 3H)
74	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(4-イソプロピルフェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.81 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.43 (dd, 1H), 7.28 (d, 2H), 7.22 (d, 2H), 6.61 (s, 1H), 4.23 (s, 2H), 3.79 (q, 2H), 2.94 - 2.85 (m, 1H), 1.21 (d, 6H), 1.05 (t, 3H)

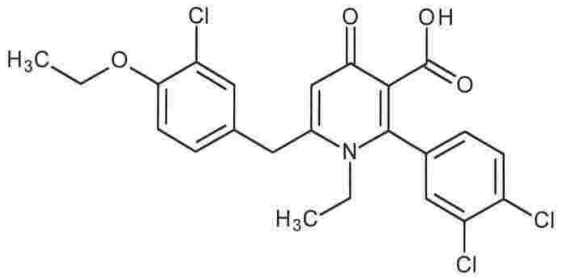
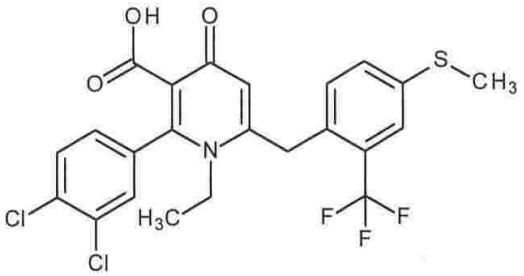
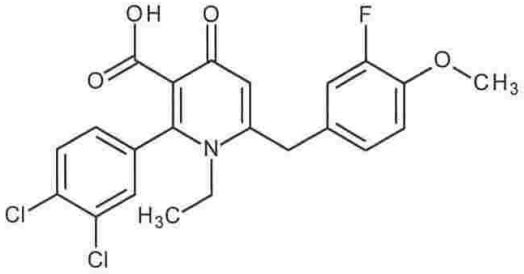
【表５－２５】

75	6-[(3-クロロ-4-フルオロ-フェニル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.80 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.61 (br d, 1H), 7.48 - 7.40 (m, 2H), 7.38 - 7.30 (m, 1H), 6.62 (s, 1H), 4.29 (s, 2H), 3.78 (q, 2H), 1.04 (t, 3H)
76	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(5-フルオロ-2-メチル-フェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.85 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.48 (dd, 1H), 7.36 - 7.31 (m, 1H), 7.14 - 7.09 (m, 1H), 7.08 - 7.04 (m, 1H), 6.20 (s, 1H), 4.22 (s, 2H), 3.83 (q, 2H), 2.23 (s, 3H), 1.14 (t, 3H)
77	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(2-フルオロ-5-メチル-フェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.26 - 7.15 (m, 3H), 6.36 (s, 1H), 4.24 (s, 2H), 3.85 (q, 2H), 2.31 (s, 3H), 1.10 (t, 3H)

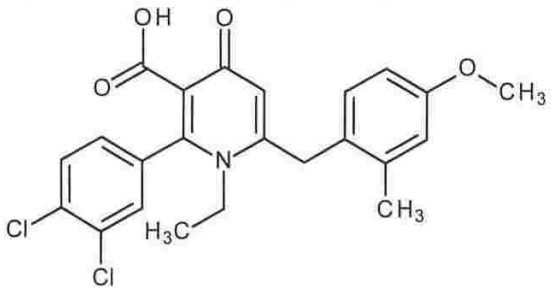
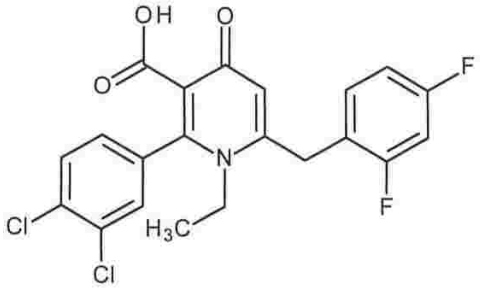
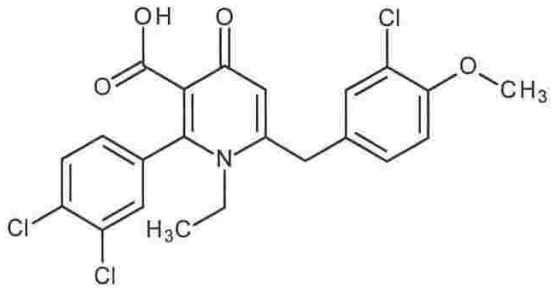
【表５－２６】

78	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(2-フルオロ-3-メトキシ-フェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.23 - 7.16 (m, 2H), 6.93 - 6.85 (m, 1H), 6.38 (s, 1H), 4.27 (s, 2H), 3.90 - 3.78 (m, 5H), 1.10 (t, 3H)
79	6-[(4-クロロ-2-フルオロ-フェニル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.56 (dd, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.44 - 7.35 (m, 2H), 6.39 (s, 1H), 4.28 (s, 2H), 3.83 (q, 2H), 1.10 (t, 3H)
80	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[[4-フルオロ-2-(トリフルオロメチル)フェニル]メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.78 (d, 2H), 7.66 - 7.60 (m, 1H), 7.54 - 7.48 (m, 1H), 7.45 (dd, 1H), 6.22 (s, 1H), 4.39 (s, 2H), 3.78 (q, 2H), 1.10 (t, 3H)

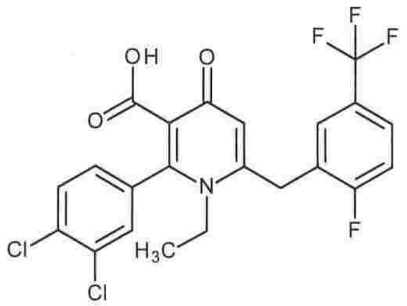
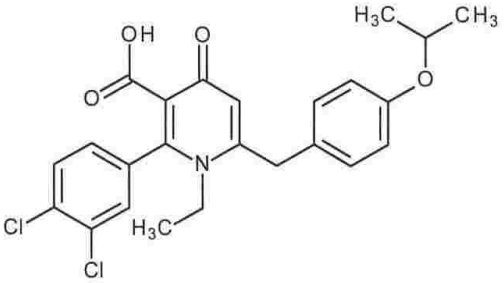
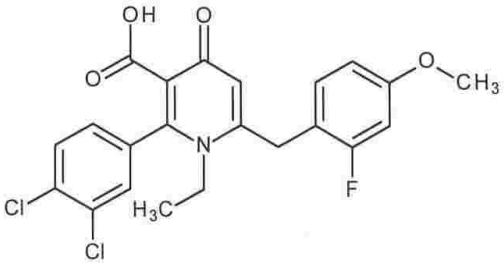
【表５－２７】

81	6-[(3-クロロ-4-エトキシ-フェニル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.80 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.44 - 7.40 (m, 2H), 7.24 - 7.20 (m, 1H), 7.17 - 7.14 (m, 1H), 6.58 (s, 1H), 4.21 (s, 2H), 4.13 (q, 2H), 3.80 (q, 2H), 1.36 (t, 3H), 1.04 (t, 3H)
82	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[[4-メチルスルファニル-2-(トリフルオロメチル)フェニル]メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.61 (br d, 1H), 7.45 (m, 1H), 7.37 (d, 1H), 6.22 (s, 1H), 4.35 (s, 2H), 3.78 (m, 2H), 2.58 (s, 3H), 1.10 (m, 3H)
83	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(3-フルオロ-4-メトキシ-フェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.80 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.47 - 7.41 (m, 1H), 7.23 - 7.16 (m, 2H), 7.09 (br d, 1H), 6.60 (s, 1H), 4.21 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.82 - 3.75 (m, 2H), 1.04 (t, 3H)

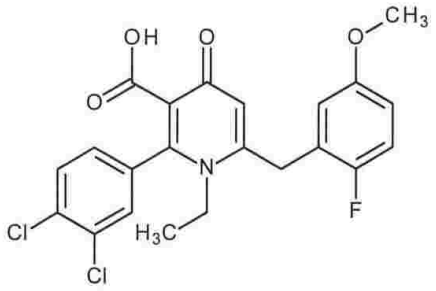
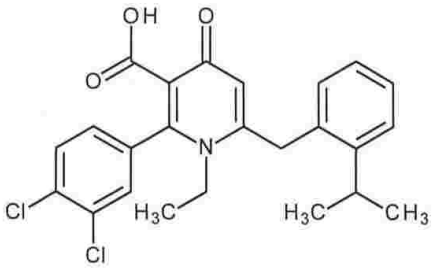
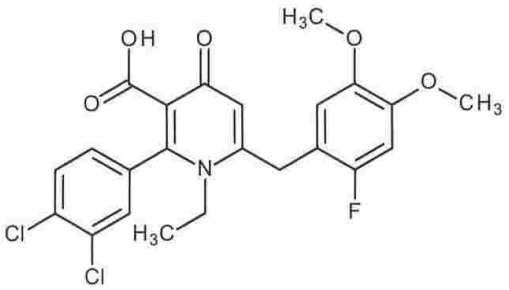
【表５－２８】

84	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(4-メトキシ-2-メチル-フェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.08 (d, 1H), 6.90 (d, 1H), 6.81 (dd, 1H), 4.14 (s, 2H), 3.86 (q, 2H), 3.77 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 1.15 (t, 3H)
85	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[(2,4-ジフルオロフェニル)メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.50 - 7.41 (m, 2H), 7.41 - 7.34 (m, 1H), 7.20 - 7.14 (m, 1H), 6.35 (s, 1H), 4.27 (s, 2H), 3.85 (q, 2H), 1.10 (t, 3H)
86	6-[(3-クロロ-4-メトキシ-フェニル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.80 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.45 - 7.40 (m, 2H), 7.25 (dd, 1H), 7.17 (d, 1H), 6.58 (s, 1H), 4.22 (s, 2H), 3.87 (s, 3H), 3.80 (q, 2H), 1.04 (t, 3H)

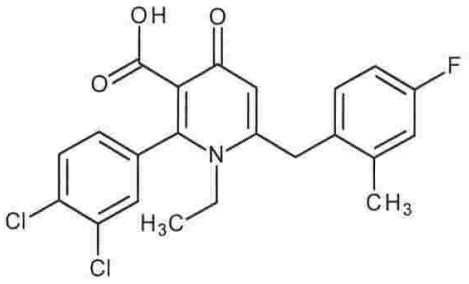
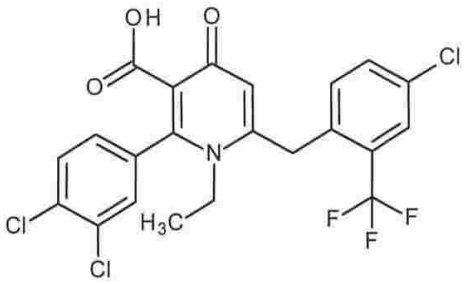
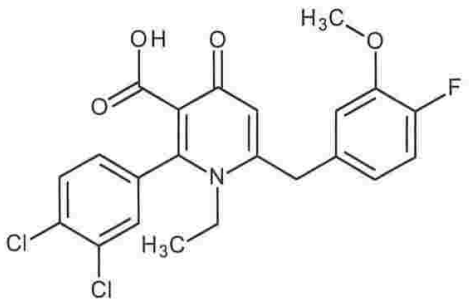
【表５－２９】

87	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[[2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.92 (br d, 1H), 7.90 - 7.86 (m, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.61 - 7.55 (m, 1H), 7.45 (dd, 1H), 6.23 (s, 1H), 4.40 (s, 2H), 3.90 (q, 2H), 1.12 (t, 3H)
88	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(4-イソプロポキシフェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.80 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.42 (dd, 1H), 7.20 (d, 2H), 6.94 (d, 2H), 6.59 (s, 1H), 4.61 (spt, 1H), 4.18 (s, 2H), 3.80 (q, 2H), 1.26 (d, 6H), 1.04 (t, 3H)
89	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(2-フルオロ-4-メトキシ-フェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.32 - 7.23 (m, 1H), 6.95 (dd, 1H), 6.86 (dd, 1H), 6.33 (s, 1H), 4.20 (s, 2H), 3.86 (q, 2H), 3.80 (s, 3H), 1.10 (t, 3H)

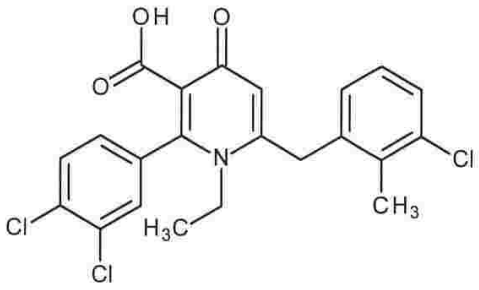
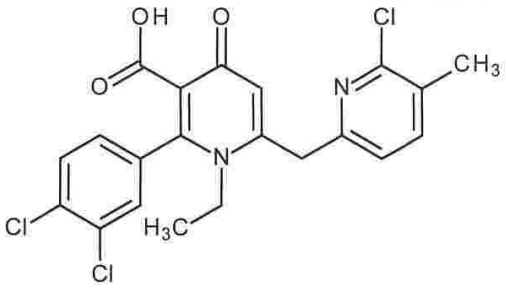
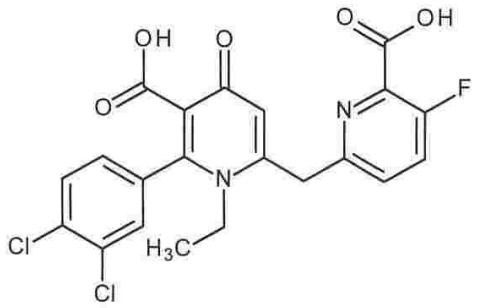
【表５－３０】

90	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(2-フルオロ-5-メトキシ-フェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.28 - 7.19 (m, 1H), 7.01 - 6.94 (m, 2H), 6.33 (s, 1H), 4.25 (s, 2H), 3.87 (q, 2H), 3.76 (s, 3H), 1.11 (t, 3H)
91	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(2-イソプロピルフェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.84 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.47 (dd, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.40 - 7.34 (m, 1H), 7.28 - 7.20 (m, 1H), 7.15 (d, 1H), 6.14 (s, 1H), 4.26 (s, 2H), 3.87 (q, 2H), 3.02 - 2.92 (m, 1H), 1.19 (d, 6H), 1.15 (t, 3H)
92	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(2-フルオロ-4,5-ジメトキシ-フェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.82 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.02 (d, 1H), 6.98 - 6.94 (m, 1H), 6.27 (s, 1H), 4.19 (s, 2H), 3.90 (m, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 1.13 (t, 3H)

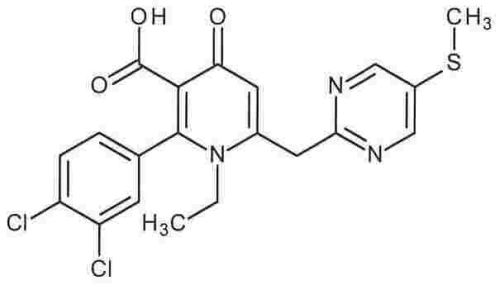
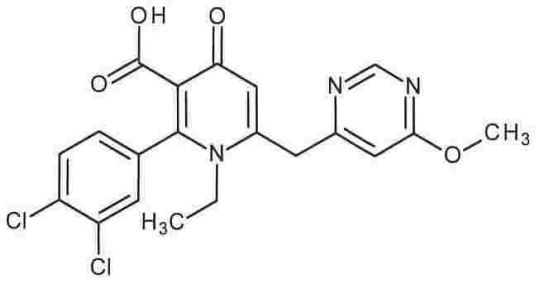
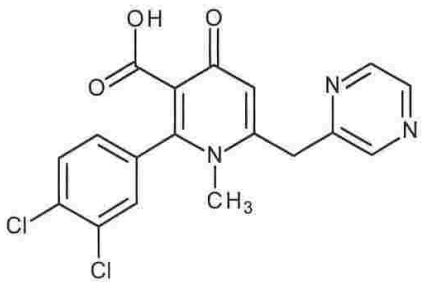
【表５－３１】

93	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(4-フルオロ-2-メチル-フェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.84 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.47 (dd, 1H), 7.23 - 7.16 (m, 2H), 7.10 - 7.05 (m, 1H), 6.15 (s, 1H), 4.20 (s, 2H), 3.84 (q, 2H), 2.27 (s, 3H), 1.14 (t, 3H)
94	6-[[4-クロロ-2-(トリフルオロメチル)フェニル]メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.93 (d, 1H), 7.84 - 7.81 (m, 2H), 7.77 (d, 1H), 7.49 - 7.43 (m, 2H), 6.28 (s, 1H), 4.40 (s, 2H), 3.75 (q, 2H), 1.09 (t, 3H)
95	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(4-フルオロ-3-メトキシ-フェニル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.79 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.42 (br d, 1H), 7.27 - 7.18 (m, 1H), 7.15 (br d, 1H), 6.89 - 6.81 (m, 1H), 6.57 (s, 1H), 4.25 (br s, 2H), 3.89 - 3.75 (m, 5H), 1.05 (br t, 3H)

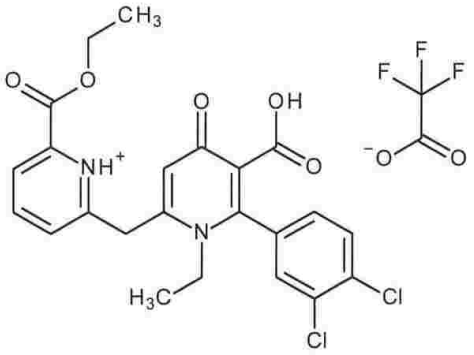
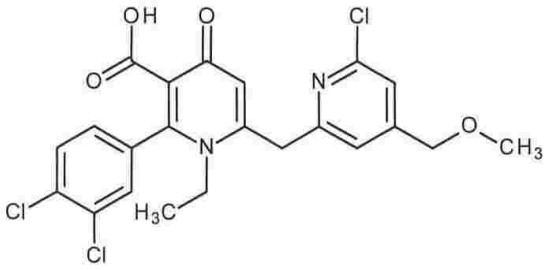
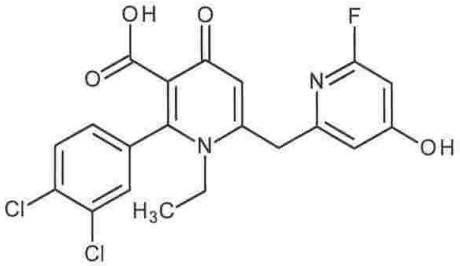
【表５－３２】

96	6-[(3-クロロ-2-メチル-フェニル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.85 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.47 (m, 2H), 7.28 (m, 1H), 7.17 (d, 1H), 6.16 (s, 1H), 4.30 (s, 2H), 3.84 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 1.15 (m, 3H)
97	6-[(6-クロロ-5-メチル-2-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.59 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.19 - 7.07 (m, 2H), 7.01 (s, 1H), 6.66 (s, 1H), 4.19 (s, 2H), 4.00 (q, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.19 (t, 3H)
98	6-[(6-カルボキシ-5-フルオロ-2-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.93 (dd, 1H), 7.81 - 7.72 (m, 3H), 7.42 (dd, 1H), 6.74 (s, 1H), 4.48 (s, 2H), 3.87 (q, 2H), 1.04 (t, 3H)

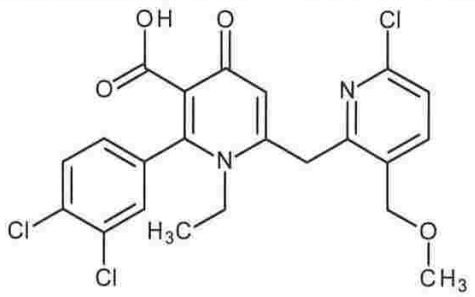
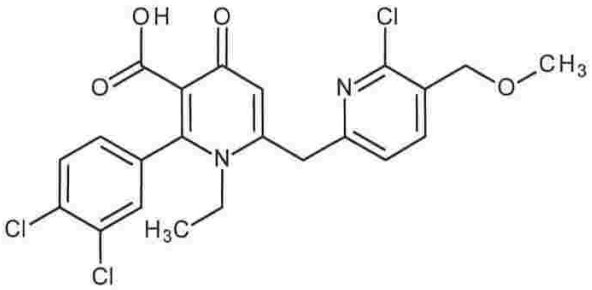
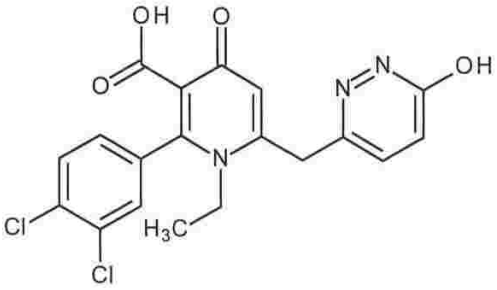
【表５－３３】

99	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(5-メチルスルファニルピリミジン-2-イル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.56 (s, 2H), 7.59 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 6.80 (s, 1H), 4.38 (s, 2H), 4.01 - 3.93 (m, 2H), 2.56 (s, 3H), 1.20 (t, 3H)
100	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(6-メトキシピリミジン-4-イル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.72 (d, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.68 - 6.67 (m, 1H), 4.14 (s, 2H), 4.02 (s, 3H), 3.97 (q, 2H), 1.21 (t, 3H)
101	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-メチル-4-オキソ-6-(ピラジン-2-イルメチル)ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.64 (d, 1H), 8.59 (d, 1H), 8.56 (dd, 1H), 7.61 - 7.58 (d, 1H), 7.38 - 7.37 (d, 1H), 7.16 - 7.13 (dd, 1H), 6.69 (s, 1H), 4.31 (s, 2H), 3.99 (q, 2H), 1.25 - 1.21 (m, 3H)

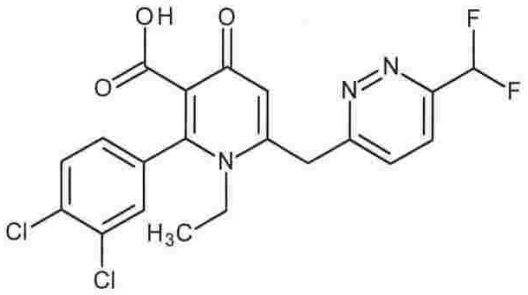
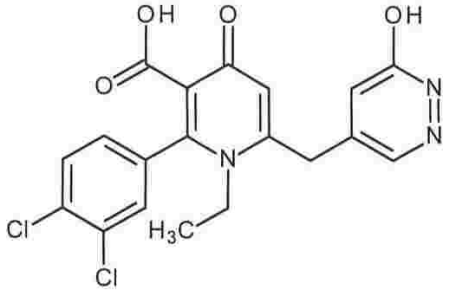
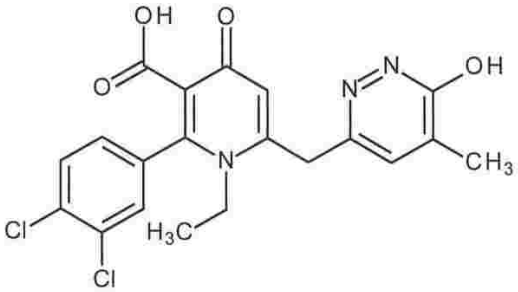
【表５－３４】

102	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[(6-エトキシカルボニルピリジン-1-イウム-2-イル)メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸;2,2,2-トリフルオロ酢酸塩	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.11 - 8.07 (m, 1H), 7.91 (t, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.52 - 7.47 (m, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.16 (dd, 1H), 6.69 (s, 1H), 4.46 (q, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.17 - 4.04 (m, 2H), 1.42 (t, 3H), 1.21 (t, 3H)
103	6-[[6-クロロ-4-(メトキシメチル)-2-ピリジル]メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.59 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.16 (s, 1H), 7.12 (dd, 1H), 6.68 (s, 1H), 4.47 (s, 2H), 4.22 (s, 2H), 3.99 (q, 2H), 3.48 (s, 3H), 1.19 (t, 3H)
104	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(6-フルオロ-4-ヒドロキシ-2-ピリジル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 7.77 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.40 (dd, 1H), 6.78 (s, 2H), 6.35 (d, 1H), 4.26 (s, 2H), 3.87 (q, 2H), 1.04 (t, 3H)

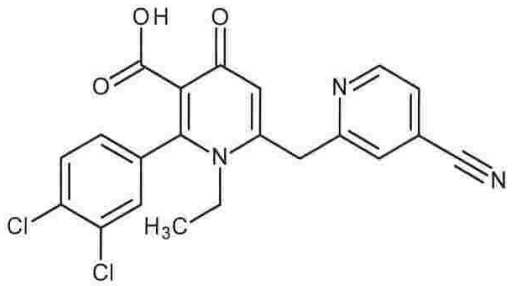
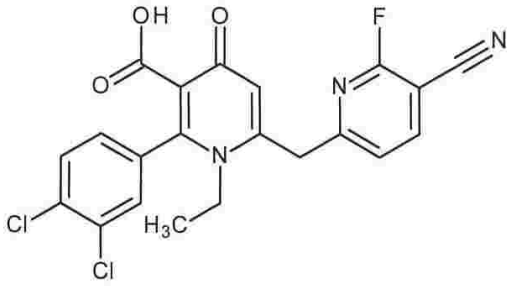
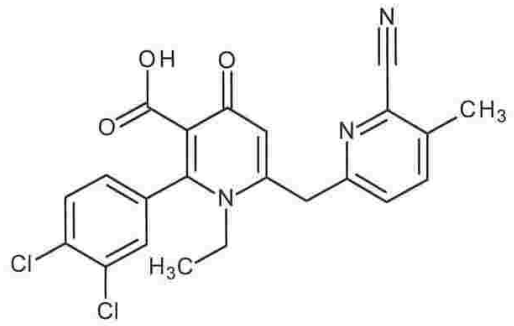
【表５－３５】

105	6-[[6-クロロ-3-(メトキシメチル)-2-ピリジル]メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.66 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.16 (dd, 1H), 6.48 (s, 1H), 4.47 (s, 2H), 4.32 (s, 2H), 3.92 (q, 2H), 3.41 (s, 3H), 1.20 (t, 3H)
106	6-[[6-クロロ-5-(メトキシメチル)-2-ピリジル]メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.88 (d, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.26 - 7.12 (m, 2H), 6.63 (s, 1H), 4.55 - 4.50 (m, 2H), 4.24 (s, 2H), 3.98 (q, 2H), 3.52 (s, 3H), 1.20 (t, 3H)
107	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(6-ヒドロキシピリダジン-3-イル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 7.61 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.12 (dd, 1H), 7.05 (d, 1H), 6.73 (s, 1H), 4.05 (s, 2H), 3.93 - 3.86 (m, 2H), 1.20 (t, 3H)

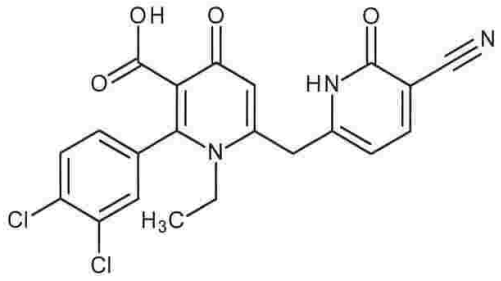
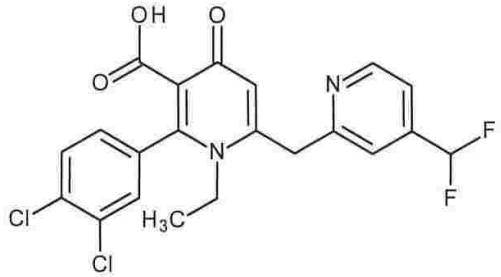
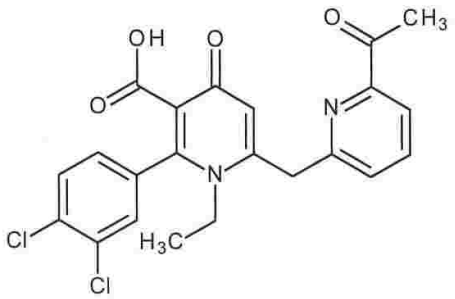
【表５－３６】

108	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[[6-(ジフルオロメチル)ピリダジン-3-イル]メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 7.89 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.17 (dd, 1H), 6.94 (t, 1H), 6.63 (s, 1H), 4.53 (s, 2H), 4.04 (q, 2H), 1.26 (t, 3H)
109	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(6-ヒドロキシピリダジン-4-イル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, メタノール) δ = 7.93 (d, 1H), 7.68 (d, 2H), 7.36 (dd, 1H), 6.81 (s, 1H), 6.70 (s, 1H), 4.25 (s, 2H), 3.88 (q, 2H), 1.18 (t, 3H)
110	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(6-ヒドロキシ-5-メチル-ピリダジン-3-イル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 7.59 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.11 (s, 1H), 6.74 (s, 1H), 4.01 (s, 2H), 3.92 (q, 2H), 2.25 (s, 3H), 1.19 (t, 3H)

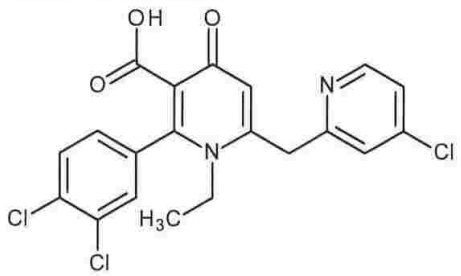
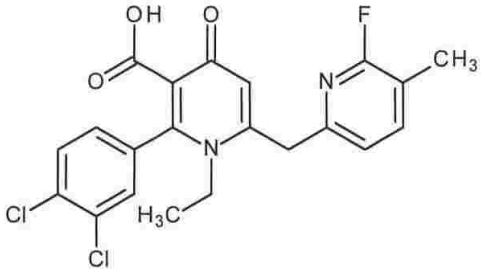
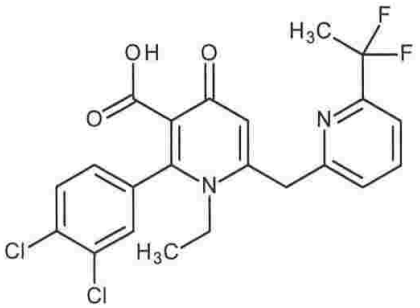
【表５－３７】

111	6-[(4-シアノ-2-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.82 (d, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.83 (dd, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.42 (dd, 1H), 6.84 (s, 1H), 4.51 (s, 2H), 3.84 (q, 2H), 1.02 (t, 3H)
112	6-[(5-シアノ-6-フルオロ-2-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.59 (t, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.43 (dd, 1H), 6.81 (s, 1H), 4.53 (s, 2H), 3.80 (q, 2H), 1.04 (t, 3H)
113	6-[(6-シアノ-5-メチル-2-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.99 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.42 (dd, 1H), 6.72 (s, 1H), 4.47 (s, 2H), 3.84 (q, 2H), 2.51 - 2.49 (m, 3H), 1.03 (t, 3H)

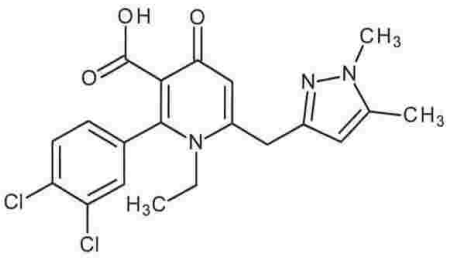
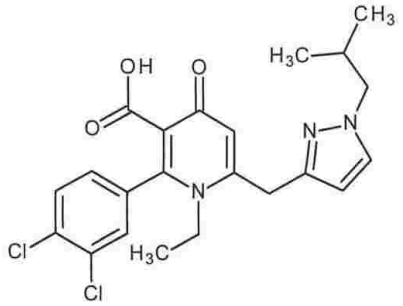
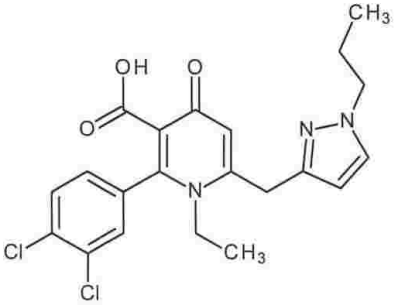
【表５－３８】

114	6-[(5-シアノ-6-オキソ-1H-ピリジン-2-イル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 12.77 (br s, 1H), 8.12 (d, 1H), 7.80 - 7.75 (m, 2H), 7.43 (dd, 1H), 6.72 (s, 1H), 6.26 (br s, 1H), 4.24 (s, 2H), 3.74 (q, 2H), 1.05 (t, 3H)
115	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[[4-(ジフルオロメチル)-2-ピリジル]メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.73 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.71 (br s, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.41 (dd, 1H), 7.27 - 7.00 (m, 1H), 6.80 (s, 1H), 4.53 (s, 2H), 3.90 (q, 2H), 1.02 (t, 3H)
116	6-[(6-アセチル-2-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.04 (t, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.79 - 7.75 (m, 1H), 7.80 - 7.75 (m, 2H), 7.42 (dd, 1H), 6.90 (s, 1H), 4.55 (s, 2H), 4.04 - 3.94 (m, 2H), 2.56 (s, 3H), 1.08 (t, 3H)

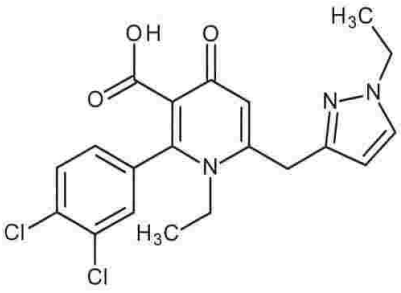
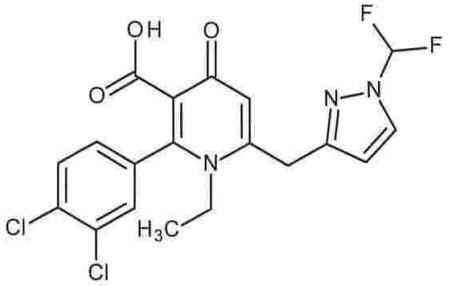
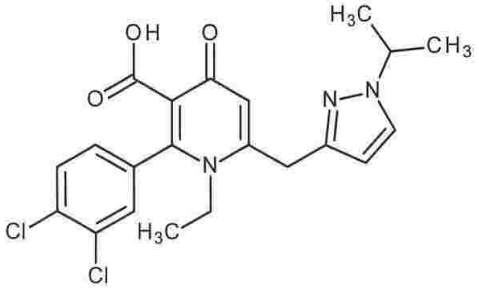
【表５－３９】

117	6-[(4-クロロ-2-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.54 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.51 (dd, 1H), 7.42 (dd, 1H), 6.83 (s, 1H), 4.45 (s, 2H), 3.88 (q, 2H), 1.02 (t, 3H)
118	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(6-フルオロ-5-メチル-2-ピリジル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.87 (dd, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.42 (dd, 1H), 7.34 (d, 1H), 6.74 (s, 1H), 4.35 (s, 2H), 3.85 (q, 2H), 2.24 (s, 3H), 1.03 (t, 3H)
119	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[[6-(1,1-ジフルオロエチル)-2-ピリジル]メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.03 (t, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.76 (s, 1H), 7.65 (br d, 1H), 7.63 (br d, 1H), 7.40 (dd, 1H), 6.81 (s, 1H), 4.51 (s, 2H), 3.90 (q, 2H), 1.95 (t, 3H), 1.04 (t, 3H)

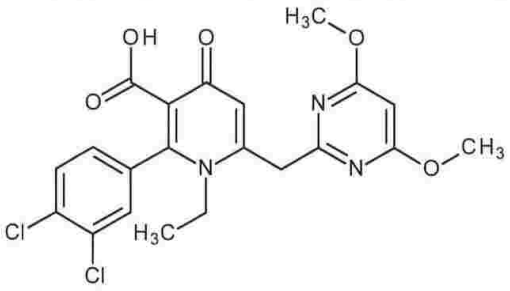
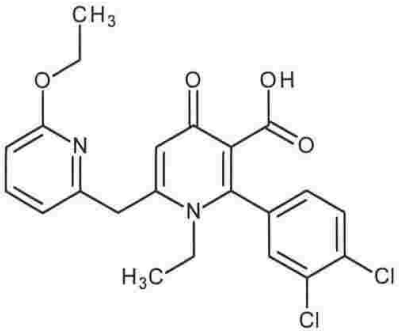
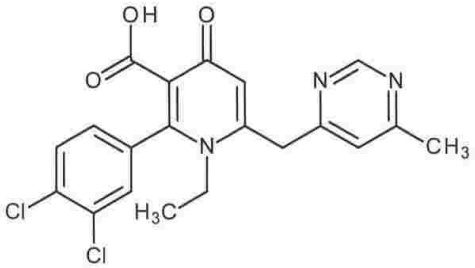
【表５－４０】

120	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[(1,5-ジメチルピラゾール-3-イル)メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.79 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.41 (dd, 1H), 6.76 (s, 1H), 6.00 (s, 1H), 4.09 (s, 2H), 3.87 (q, 2H), 3.68 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 1.06 (t, 3H)
121	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(1-イソブチルピラゾール-3-イル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.77 - 7.73 (m, 2H), 7.72 (d, 1H), 7.40 (dd, 1H), 6.71 (s, 1H), 6.21 (d, 1H), 4.19 (s, 2H), 3.92 - 3.84 (m, 4H), 2.13 - 2.02 (m, 1H), 1.04 (t, 3H), 0.82 (d, 6H)
122	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-[(1-プロピルピラゾール-3-イル)メチル]ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.78 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.41 (dd, 1H), 6.72 (s, 1H), 6.20 (d, 1H), 4.19 (s, 2H), 4.04 (t, 2H), 3.87 (q, 2H), 1.76 (m, 2H), 1.03 (t, 3H), 0.81 (t, 3H)

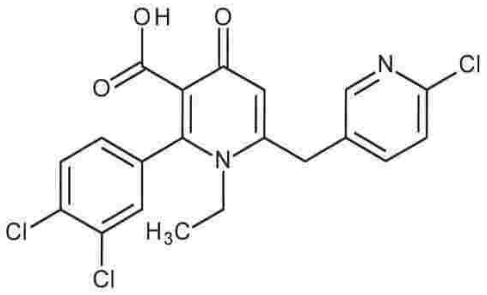
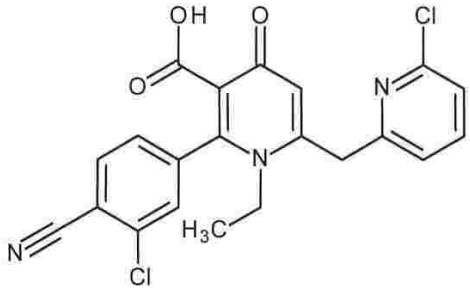
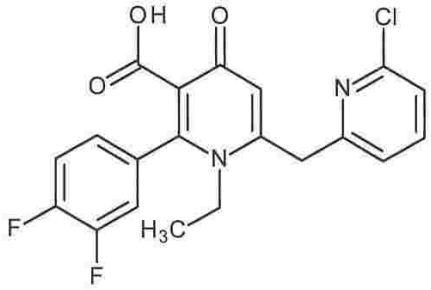
【表５－４１】

123	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(1-エチルピラゾール-3-イル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.79 (d, 1H), 7.77 - 7.73 (m, 2H), 7.41 (dd, 1H), 6.74 (s, 1H), 6.20 (d, 1H), 4.19 (s, 2H), 4.11 (q, 2H), 3.88 (q, 2H), 1.35 (t, 3H), 1.03 (t, 3H)
124	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[[1-(ジフルオロメチル)ピラゾール-3-イル]メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.26 (d, 1H), 7.92 - 7.65 (m, 2H), 7.76 (d, 1H), 7.42 (dd, 1H), 6.75 (s, 1H), 6.56 (d, 1H), 4.31 (s, 2H), 3.85 (q, 2H), 1.03 (t, 3H)
125	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(1-イソプロピルピラゾール-3-イル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.80 - 7.78 (m, 1H), 7.80 - 7.74 (m, 1H), 7.77 - 7.73 (m, 1H), 7.41 (dd, 1H), 6.72 (s, 1H), 6.19 (d, 1H), 4.47 (m, 1H), 4.20 (s, 2H), 3.88 (q, 2H), 1.40 (d, 6H), 1.02 (t, 3H)

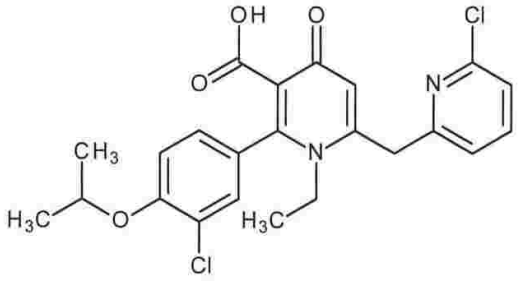
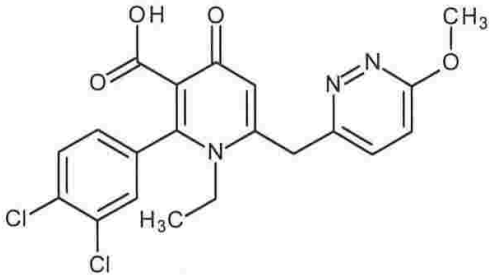
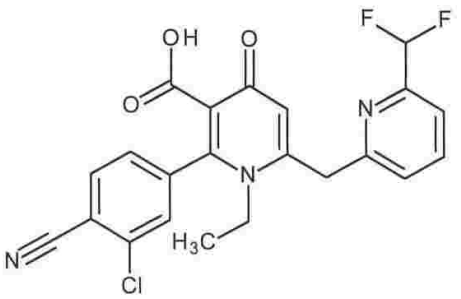
【表５－４２】

126	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.59 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.85 (s, 1H), 5.96 (s, 1H), 4.23 (s, 2H), 4.08 - 4.01 (m, 2H), 3.89 (s, 6H), 1.23 (t, 3H)
127	2-(3,4-ジクロロフェニル)-6-[(6-エトキシ-2-ピリジル)メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.61 - 7.56 (m, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.11 (dd, 1H), 6.80 (d, 1H), 6.75 (s, 1H), 6.67 (d, 1H), 4.22 (q, 2H), 4.15 (s, 2H), 4.14 - 3.96 (m, 2H), 1.36 (t, 3H), 1.20 (t, 3H)
128	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(6-メチルピリミジン-4-イル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 9.04 (d, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.71 (s, 1H), 4.20 (s, 2H), 3.98 (q, 2H), 2.58 (s, 3H), 1.21 (t, 3H)

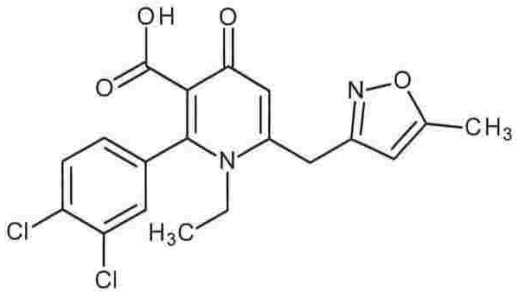
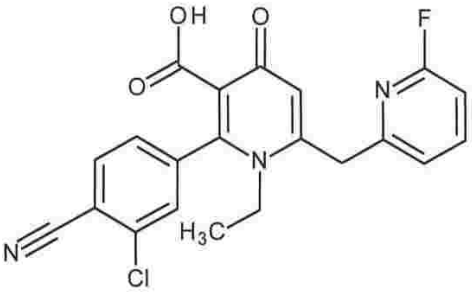
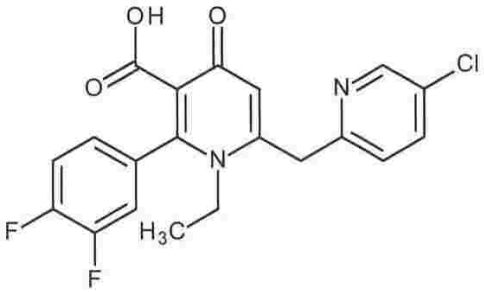
【表５－４３】

129	6-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 8.28 (d, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.54 (dd, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 6.49 (s, 1H), 4.10 (s, 2H), 3.86 - 3.77 (m, 2H), 1.23 (t, 3H)
130	2-(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)-6-[(6-クロロ-2-ピリジル)メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 7.85 (d, 1H), 7.75 (t, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.37 - 7.33 (m, 2H), 7.27 (d, 1H), 6.71 (s, 1H), 4.28 (s, 2H), 3.98 (q, 2H), 1.21 (t, 3H)
131	6-[(6-クロロ-2-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジフルオロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 7.72 (t, 1H), 7.37 - 7.28 (m, 2H), 7.21 (d, 1H), 7.12 (ddd, 1H), 7.05 - 6.97 (m, 1H), 6.68 (s, 1H), 4.25 (s, 2H), 4.01 (q, 2H), 1.20 (t, 3H)

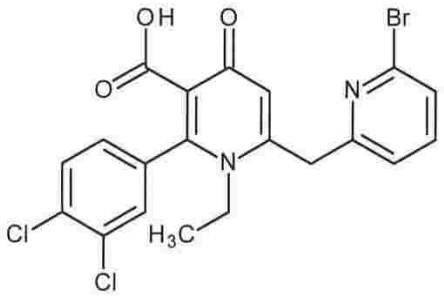
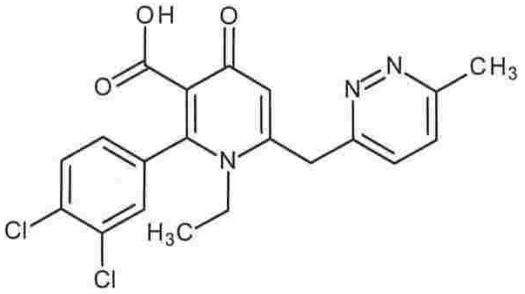
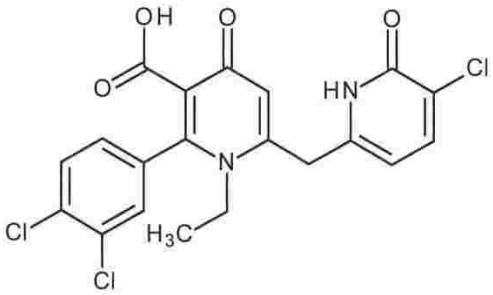
【表５－４４】

132	2-(3-クロロ-4-イソプロポキシ-フェニル)-6-[(6-クロロ-2-ピリジル)メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.71 (t, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.23 (d, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.09 - 7.05 (m, 1H), 7.04 - 7.00 (m, 1H), 6.66 (s, 1H), 4.64 (spt, 1H), 4.24 (s, 2H), 4.00 (q, 2H), 1.43 (dd, 6H), 1.19 - 1.15 (m, 3H)
133	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(6-メトキシピリダジン-3-イル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 7.58 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.14 (dd, 1H), 7.05 (d, 1H), 6.73 (s, 1H), 4.35 (s, 2H), 4.14 (s, 3H), 4.07 (q, 2H), 1.22 (t, 3H)
134	2-(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)-6-[[6-(ジフルオロメチル)-2-ピリジル]メチル]-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, メタノール) δ = 7.98 (t, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.41 (dd, 1H), 6.77 (s, 1H), 6.75 - 6.45 (m, 1H), 4.44 (s, 2H), 4.01 (q, 2H), 1.20 (t, 3H)

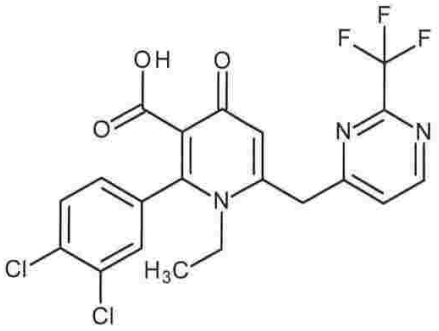
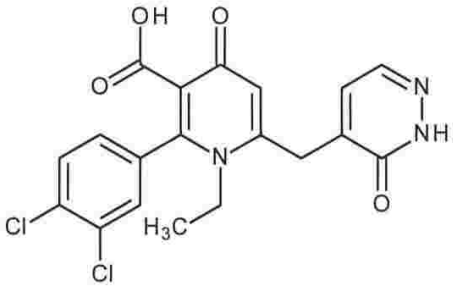
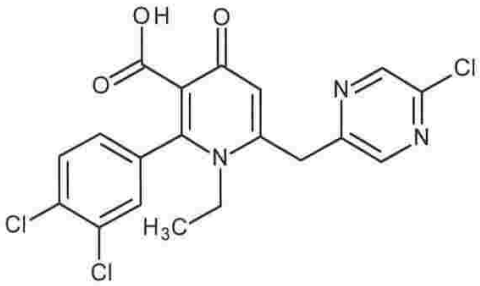
【表５－４５】

135	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(5-メチルイソキサゾール-3-イル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.59 (d, 1H), 7.34 (d, 1H), 7.10 (dd, 1H), 6.79 (s, 1H), 5.96 (s, 1H), 4.10 (s, 2H), 3.93 (q, 2H), 2.48 - 2.45 (m, 3H), 1.19 (t, 3H)
136	2-(3-クロロ-4-シアノ-フェニル)-1-エチル-6-[(6-フルオロ-2-ピリジル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 7.96 - 7.78 (m, 2H), 7.47 (d, 1H), 7.33 (dd, 1H), 7.19 (dd, 1H), 6.94 (dd, 1H), 6.70 (s, 1H), 4.23 (s, 2H), 3.98 (q, 2H), 1.21 (t, 3H)
137	6-[(5-クロロ-2-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジフルオロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.61 (s, 1H), 7.99 (dd, 1H), 7.65 - 7.52 (m, 3H), 7.26 - 7.25 (m, 1H), 6.78 (s, 1H), 4.44 (s, 2H), 3.86 (q, 2H), 1.02 (t, 3H)

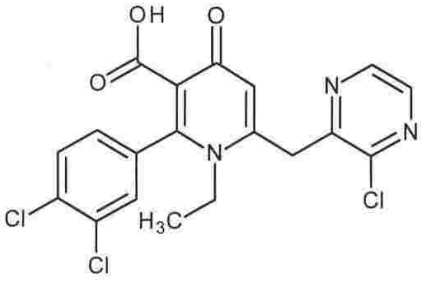
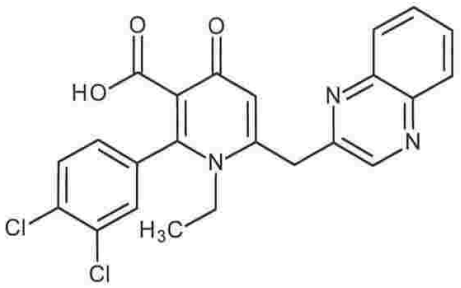
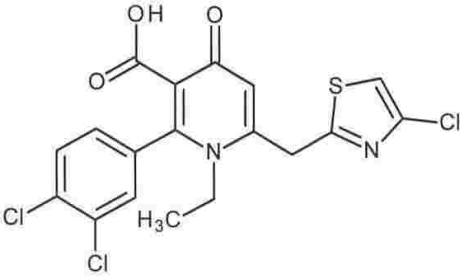
【表５－４６】

138	6-[(6-ブロモ-2-ピリジル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.63 - 7.58 (m, 2H), 7.48 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.65 (s, 1H), 4.24 (s, 2H), 3.99 (q, 2H), 1.19 (t, 3H)
139	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(6-メチルピリダジン-3-イル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 7.58 (d, 1H), 7.41 (s, 2H), 7.37 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 6.70 (s, 1H), 4.42 (s, 2H), 4.08 (q, 2H), 2.75 (s, 3H), 1.23 (t, 3H)
140	6-[(5-クロロ-6-オキソ-1H-ピリジン-2-イル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, DMSO-d6) δ = 8.18 - 8.13 (m, 1H), 7.80 - 7.75 (m, 2H), 7.72 (d, 1H), 7.42 (dd, 1H), 6.63 (s, 1H), 4.16 (s, 2H), 3.76 (br d, 2H), 1.91 (s, 1H), 1.06 (m, 3H)

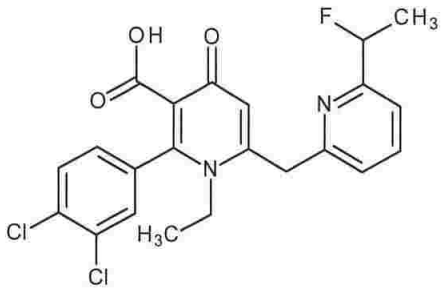
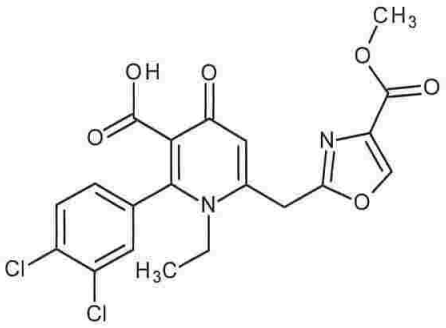
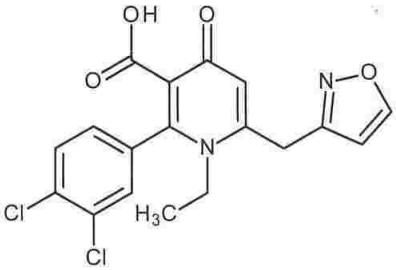
【表５－４７】

141	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-[[2-(トリフルオロメチル)ピリミジン-4-イル]メチル]ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.96 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.66 (s, 1H), 4.35 (s, 2H), 4.02 - 3.99 (m, 2H), 1.23 (t, 3H)
142	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-[(6-オキソ-1H-ピリダジン-5-イル)メチル]ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, DMSO-d6) δ = 13.26 (s, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.86 - 7.82 (m, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.30 (d, 1H), 6.73 (s, 1H), 4.05 (s, 2H), 3.76 (q, 2H), 1.09 (t, 3H)
143	6-[(5-クロロピラジン-2-イル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 8.57 (d, 1H), 8.44 - 8.39 (m, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 6.66 (s, 1H), 4.29 (s, 2H), 3.97 (q, 2H), 1.24 (t, 3H)

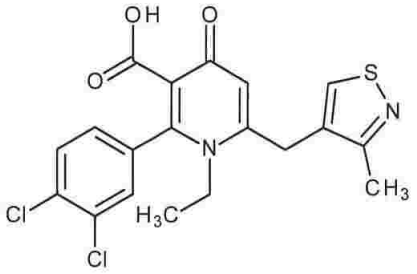
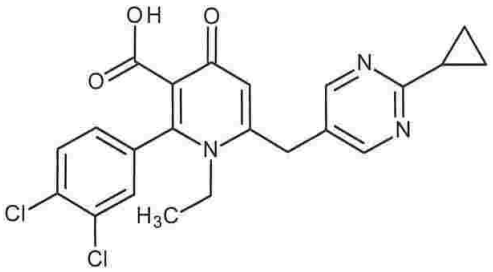
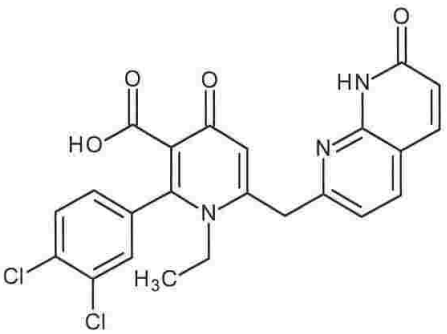
【表５－４８】

144	6-[(3-クロロピラジン-2-イル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, メタノール) δ = 8.54 (d, 1H), 8.42 (d, 1H), 7.70 - 7.65 (m, 2H), 7.36 (dd, 1H), 6.62 (s, 1H), 4.62 (s, 2H), 3.91 (q, 2H), 1.20 (t, 3H)
145	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-(キノキサリン-2-イルメチル)ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 8.88 (s, 1H), 8.18 - 8.14 (m, 1H), 8.04 - 7.99 (m, 1H), 7.86 - 7.81 (m, 2H), 7.59 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.14 (dd, 1H), 6.80 (s, 1H), 4.52 (s, 2H), 4.04 (q, 2H), 1.25 (t, 3H)
146	6-[(4-クロロチアゾール-2-イル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 7.60 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.18 - 7.12 (m, 2H), 6.78 (s, 1H), 4.43 (s, 2H), 3.98 (q, 2H), 1.21 (t, 3H)

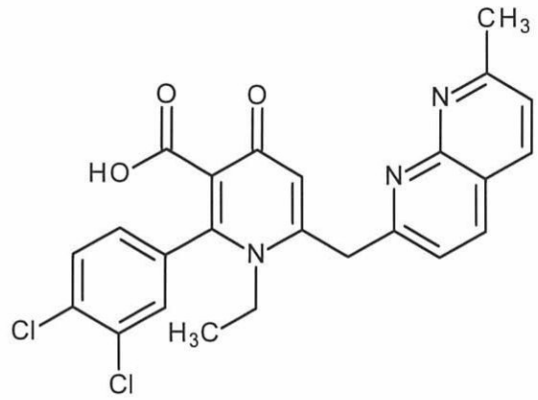
【表５－４９】

147	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[[6-(1-フルオロエチル)-2-ピリジル]メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.79 (t, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.34 (dd, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.11 (dt, 1H), 6.71 (s, 1H), 5.70 - 5.50 (m, 1H), 4.27 (s, 2H), 4.00 (q, 2H), 1.67 - 1.58 (m, 3H), 1.18 (t, 3H)
148	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(4-メトキシカルボニルオキサゾール-2-イル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 8.27 (s, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.37 (s, 1H), 7.13 (d, 1H), 6.79 (s, 1H), 4.32 (s, 2H), 4.00 - 3.95 (m, 2H), 3.93 (s, 3H), 1.20 (t, 3H)
149	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-(イソキサゾール-3-イルメチル)-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.50 (d, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.34 (d, 1H), 7.11 (dd, 1H), 6.80 (s, 1H), 6.36 (d, 1H), 4.19 (s, 2H), 3.93 (q, 2H), 1.20 (t, 3H)

【表５－５０】

150	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(3-メチルイソチアゾール-4-イル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 8.36 (s, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.15 (dd, 1H), 6.44 (s, 1H), 4.07 (s, 2H), 3.84 (q, 2H), 2.46 (s, 3H), 1.26 (t, 3H)
151	6-[(2-シクロプロピルピリミジン-5-イル)メチル]-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 8.43 (s, 2H), 7.59 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 6.49 (s, 1H), 4.03 (s, 2H), 3.84 (q, 2H), 2.32 - 2.25 (m, 1H), 1.25 (t, 3H), 1.20 - 1.12 (m, 4H)
152	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-[(7-オキソ-8H-1,8-ナフチリジン-2-イル)メチル]ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 10.57 (br s, 1H), 7.93 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.49 - 7.47 (m, 1H), 7.22 - 7.18 (m, 1H), 7.16 (d, 1H), 6.74 - 6.68 (m, 2H), 4.35 (s, 2H), 3.99 (q, 2H), 1.20 (t, 3H)

【表５－５１】

153	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-[(7-メチル-1,8-ナフチリジン-2-イル)メチル]-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 8.24 (d, 1H), 8.15 (d, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.46 (d, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.10 (dd, 1H), 6.85 (s, 1H), 4.51 (s, 2H), 4.17 - 4.02 (m, 2H), 2.84 (s, 3H), 1.18 (t, 3H)

【０１８０】

生物学的実施例

多様なテスト種の種子を標準土壌に播種する（アメリカアサガオ（Ｉｐｏｍｏｅａ ｈｅｄｅｒａｃｅａ）（ＩＰＯＨＥ）、トウモロコシ（Ｚｅａ ｍａｙｓ）（ＺＥＡＭＸ）、イヌビエ（Ｅｃｈｉｎｏｃｈｌｏａ ｃｒｕｓ－ｇａｌｌｉ）（ＥＣＨＣＧ）、オオホナガアオゲイトウ（Ａｍａｒａｎｔｈｕｓ ｐａｌｍｅｒｉ）（ＡＭＡＰＡ）、（アオゲイトウ（Ａｍａｒａｎｔｈｕｓ ｒｅｔｏｆｌｅｘｕｓ）（ＡＭＡＲＥ）、及び（アキノエノコログサ（Ｓｅｔａｒｉａ ｆａｂｅｒｉ）（ＳＥＴＦＡ））。制御された条件下に温室（２４℃／１６℃、昼／夜；１４時間の明かり；６５％湿度）で８日間栽培した後、０．５％Ｔｗｅｅｎ ２０（ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、ＣＡＳ ＲＮ ９００５－６４－５）を含有するアセトン／水（５０：５０）溶液中の技術的有効成分の配合物から得られた水性噴霧溶液を植物に噴霧する。施用量は以下の表においてｇ／ｈａで示す。次いで、テスト植物を、制御された条件下に、温室（２４℃／１６℃、昼／夜；１４時間の明かり；６５％湿度）で温室栽培し、１日２回水やりをした。１３日後、植物にもたらされた損傷の割合について、テストを評価する。生物学的活性を５段階で以下の表に示す（５＝８１～１００％；４＝６１～８０％；３＝４１～６０％；２＝２１～４０％；１＝０～２０％；－＝テストせず）。

【０１８１】

【表６－１】

表 B1:発芽前テスト

化合物 No.	施用量 (g/Ha)	IPOHE	ZEAMX	ECHCG	AMAPA	AMARE	SETFA
3	1000	0	0	0	1	1	3
4	1000	1	2	4	0	1	5
5	1000	2	2	4	1	1	5
6	1000	0	0	0	2	1	3
7	1000	0	0	0	1	0	0
9	250	0	0	0	1	0	2
11	250	0	1	0	1	0	0
12	1000	3	1	3	1	0	5
13	1000	1	1	1	3	1	1
14	1000	4	2	3	3	2	5
16	1000	0	1	0	1	1	1
17	250	0	0	0	0	0	1
18	1000	2	1	0	1	1	1
19	1000	3	1	1	0	0	5
20	250	1	0	0	0	0	–
22	250	1	0	0	0	0	–
28	1000	0	0	2	0	0	–
29	1000	–	0	1	0	0	–
37	1000	0	0	1	0	0	–
39	1000	2	3	5	0	1	–
40	250	0	0	0	1	3	1
41	250	2	0	4	0	0	4
42	250	2	0	0	0	1	1
43	250	4	0	4	0	1	4
44	250	2	0	4	1	2	5
45	250	1	0	0	0	0	–
46	250	3	0	2	3	1	–

【表６－２】

49	250	0	0	1	2	0	–
50	1000	2	3	5	1	3	–
51	1000	0	0	1	0	0	–
52	1000	4	5	5	2	3	–
53	1000	4	4	4	1	2	–
54	1000	3	5	5	0	0	–
55	1000	2	1	5	2	2	–
57	1000	3	1	4	1	1	–
59	1000	4	3	5	2	2	–
60	250	1	0	1	1	1	0
61	1000	2	1	4	1	2	–
63	1000	0	0	3	0	0	3
65	1000	1	0	3	1	1	3
67	250	0	0	3	0	0	3
68	1000	0	0	1	1	1	2
69	1000	0	0	3	0	0	3
72	250	0	1	0	2	1	1
75	1000	1	0	2	2	4	4
78	1000	1	2	3	2	2	3
79	1000	0	0	0	0	0	0
83	1000	0	0	2	0	0	2
85	1000	1	2	4	3	3	5
86	250	0	0	2	0	1	2
89	250	0	0	1	1	1	2
90	1000	1	0	2	0	0	2
95	1000	1	0	1	0	0	4
97	1000	3	1	3	0	0	4
98	1000	1	0	2	1	2	2
99	250	0	0	0	1	1	2
100	250	4	0	0	1	0	2
101	250	4	1	1	3	2	4
102	1000	0	0	2	0	0	2
103	1000	0	0	2	0	0	4

【表６－３】

105	250	1	1	1	0	0	1
106	1000	3	3	4	4	5	5
107	1000	0	0	0	0	0	0
108	1000	3	0	3	0	0	5
111	250	1	1	0	1	1	1
112	62.5	0	0	0	0	0	1
113	250	1	0	3	0	0	2
115	250	3	0	1	1	1	4
116	250	0	1	1	1	1	3
117	62.5	3	0	1	3	1	2
118	250	2	1	4	2	2	4
119	250	2	3	4	1	2	5
120	250	0	0	0	0	0	3
121	250	4	0	4	1	1	5
122	250	3	3	4	1	1	4
123	250	4	4	4	1	1	5
124	62.5	2	0	4	0	0	5
125	250	4	3	4	1	1	3
126	250	2	0	3	1	5	4
127	250	0	0	0	0	0	1
128	250	4	0	0	1	1	1
129	250	2	1	1	0	1	1
130	250	1	3	3	0	1	4
131	250	2	2	3	1	2	5
132	250	0	0	0	1	0	1
133	250	3	0	3	1	1	1
134	250	3	4	5	1	1	5
135	250	0	0	0	0	2	1
136	250	4	4	4	1	2	5
138	250	1	0	3	1	1	4
139	250	1	1	1	2	1	0
141	250	1	0	1	0	1	4
142	250	1	0	0	1	1	0

【表６－４】

143	250	3	0	0	0	1	1
144	250	0	0	0	0	1	0
145	250	0	0	1	1	0	0
146	250	1	2	2	2	1	2
147	250	3	1	2	0	1	4
148	250	0	0	0	1	2	1
149	250	2	0	1	1	2	4
150	250	0	0	1	1	1	1
151	250	0	0	0	1	1	1

【０１８２】

【表７－１】

表 B2:発芽後テスト

化合物 No.	施用量 (g/Ha)	IPOHE	AMARE	AMAPA	ECHCG	ZEAMX	SETFA
1	1000	1	1	1	1	0	–
2	1000	1	0	1	1	0	1
3	1000	3	0	1	4	–	5
4	1000	3	2	2	3	4	4
5	1000	2	2	2	3	4	3
6	1000	3	1	2	1	1	3
7	1000	2	3	4	2	1	3
8	250	1	0	0	0	0	0
9	250	1	0	1	0	0	0
10	1000	2	1	1	0	0	0
11	250	1	1	1	0	0	0
12	1000	3	2	2	3	0	4
13	1000	2	5	5	4	4	5
14	1000	4	3	2	4	2	4
15	1000	1	1	1	0	1	0
16	1000	1	0	0	0	0	0
17	250	3	0	0	0	0	2
18	1000	3	2	2	3	1	3
19	1000	2	1	1	3	3	3
20	250	3	1	1	4	2	–
21	250	3	0	0	2	1	–
22	250	3	1	1	3	1	–
23	1000	0	1	1	0	0	–
24	1000	0	1	1	0	0	–
25	1000	0	1	1	0	1	–
26	1000	1	1	1	0	0	–
27	1000	1	3	2	1	1	–

【表７－２】

28	1000	1	1	1	3	0	–
29	1000	2	1	1	2	0	–
30	1000	1	1	1	1	0	–
31	1000	0	1	1	0	0	–
34	1000	0	1	1	0	0	–
37	1000	2	2	2	3	0	–
38	1000	0	1	1	0	0	–
39	1000	3	3	4	4	4	–
40	250	3	2	1	0	1	1
41	250	3	3	2	4	0	4
42	250	3	2	1	1	0	2
43	250	4	1	0	4	2	4
44	250	3	3	3	4	2	4
45	250	1	1	1	0	1	–
46	250	3	1	1	0	1	–
49	250	1	1	2	1	1	–
50	1000	4	4	3	4	2	–
51	1000	2	2	2	2	2	–
52	1000	3	4	4	3	3	–
53	1000	4	4	4	4	4	–
54	1000	3	3	3	4	4	–
55	1000	3	4	3	4	2	–
57	1000	1	1	1	4	0	–
59	1000	3	3	3	4	3	–
60	250	3	1	1	2	2	2
61	1000	4	4	3	4	3	
65	1000	1	2	2	1	1	2
67	250	2	1	0	0	1	0
68	1000	1	0	0	0	1	1
69	1000	1	0	0	0	1	1
72	250	3	1	1	0	0	2
75	1000	2	0	0	1	0	4
78	1000	3	2	4	1	1	2

【表７－３】

79	1000	2	4	3	3	1	3
83	1000	3	2	2	1	1	2
85	1000	2	4	4	4	3	4
86	250	1	0	0	1	1	1
89	250	2	0	0	0	1	0
90	1000	–	2	2	0	0	1
95	1000	–	2	2	2	1	4
97	1000	4	4	3	4	3	4
98	1000	0	2	2	2	0	3
99	250	3	1	1	1	1	3
100	250	4	4	4	2	2	3
101	250	3	3	2	4	2	4
102	1000	2	1	2	1	0	2
103	1000	3	4	4	4	1	4
104	1000	0	1	1	1	1	–
105	250	3	1	1	3	1	2
106	1000	4	5	4	5	4	4
107	1000	0	0	1	0	0	1
108	1000	4	3	3	4	3	5
112	62.5	2	1	1	1	1	1
113	250	3	0	0	3	1	3
114	250	1	0	0	0	0	0
115	250	3	4	3	3	3	4
116	250	4	1	0	1	2	2
117	62.5	3	4	3	3	0	4
118	250	4	3	2	4	4	4
119	250	3	3	2	4	3	4
120	250	3	0	0	1	1	4
121	250	3	1	1	4	3	4
122	250	3	1	2	4	3	4
123	250	4	2	2	4	4	4
124	62.5	4	2	1	4	4	4
125	250	3	1	1	4	3	4

【表７－４】

126	250	4	0	0	4	4	4
127	250	1	1	1	0	0	0
128	250	4	2	1	3	0	4
129	250	3	2	2	1	0	3
130	250	4	2	2	3	1	3
131	250	4	3	2	4	4	3
132	250	0	1	0	1	1	2
133	250	4	2	1	2	4	1
134	250	4	2	1	3	3	3
135	250	3	1	2	0	1	0
136	250	4	4	4	3	4	3
138	250	4	1	1	3	3	3
139	250	4	1	2	0	0	1
141	250	4	1	3	1	1	3
142	250	1		1	1	1	1
143	250	3	3	2	1	0	3
144	250	2	1	1	1	1	2
145	250	3	2	2	1	1	1
146	250	2	1	1	1	1	2
147	250	4	2	1	3	3	3
148	250	2	1	0	1	0	1
149	250	4	1	1	1	0	2
150	250	4	1	1	1	0	1
151	250	3	1	0	1	0	1

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/064174

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. C07D213/55 A01N43/40 A01N43/54 A01N43/78 C07D401/06
C07D417/06 A01P13/00
ADD.
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
C07D A01N A01P

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

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	ZHOU HAIBO ET AL: "Penipyridones A-F, Pyridone Alkaloids from Penicillium funiculosum", JOURNAL OF NATURAL PRODUCTS , vol. 79, no. 7 30 June 2016 (2016-06-30), pages 1783-1790, XP055975240, US ISSN: 0163-3864, DOI: 10.1021/acs.jnatprod.6b00218 Retrieved from the Internet: URL:https://pubs.acs.org/doi/pdf/10.1021/acs.jnatprod.6b00218 Scheme 1; compound 12 ----- -/--	1-15

[x] Further documents are listed in the continuation of Box C.
[x] See patent family annex.

* Special categories of cited documents :
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X" document of particular relevance;; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y" document of particular relevance;; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
19 June 2023	05/07/2023

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

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/064174

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 0 040 082 A1 (ROHM & HAAS [US]) 18 November 1981 (1981-11-18) cited in the application the whole document	1-15
A	US 4 714 492 A (CARLSON GLENN R [US]) 22 December 1987 (1987-12-22) the whole document	1-15
A	EP 0 239 391 A2 (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO [JP]; IHARA CHEMICAL IND CO [JP]) 30 September 1987 (1987-09-30) cited in the application the whole document	1-15

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2023/064174

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0040082 A1	18-11-1981	AT 7195 T	15-05-1984
		AU 539399 B2	27-09-1984
		EG 15674 A	30-09-1986
		EP 0040082 A1	18-11-1981
		ES 8304404 A1	01-03-1983
		IL 62855 A	31-05-1984
		JP S6366314 B2	20-12-1988
		JP S57114573 A	16-07-1982
		NZ 197027 A	16-03-1984
		ZA 813029 B	26-05-1982
US 4714492 A	22-12-1987	NONE	
EP 0239391 A2	30-09-1987	CA 1317599 C	11-05-1993
		DE 3789153 T2	07-07-1994
		EP 0239391 A2	30-09-1987
		JP H01163171 A	27-06-1989
		JP H07121911 B2	25-12-1995
		US 4757081 A	12-07-1988
		US 4871751 A	03-10-1989

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (April 2005)

フロントページの続き

(51)国際特許分類			FI			テーマコード（参考）
C07D	*471/04*	*(2006.01)*	C07D	471/04	113	
A01P	*13/00*	*(2006.01)*	A01P	13/00		
A01N	*43/40*	*(2006.01)*	A01N	43/40	101Q	
A01N	*43/54*	*(2006.01)*	A01N	43/54	B	
A01N	*43/78*	*(2006.01)*	A01N	43/78	B	
A01N	*47/02*	*(2006.01)*	A01N	47/02		
A01N	*43/60*	*(2006.01)*	A01N	43/60		
A01N	*43/56*	*(2006.01)*	A01N	43/54	F	
A01N	*43/58*	*(2006.01)*	A01N	43/56	B	
A01N	*43/80*	*(2006.01)*	A01N	43/54	A	
A01N	*43/76*	*(2006.01)*	A01N	43/58	A	
A01N	*43/90*	*(2006.01)*	A01N	43/80	101	
			A01N	43/60	101	
			A01N	43/76		
			A01N	43/80	102	
			A01N	43/90	103	

,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,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

（特許庁注：以下のものは登録商標）

１．ＴＷＥＥＮ

(74)代理人　100212509
弁理士　太田 知子
(72)発明者　イングラム キャサリン メアリー
イギリス アールジー４２ ６イーワイ バークシャー ブラックネル シンジェンタ ジーロズ ヒル インターナショナル リサーチ センター シンジェンタ リミテッド内
(72)発明者　クリストファーセン アビー ルイーズ
イギリス アールジー４２ ６イーワイ バークシャー ブラックネル シンジェンタ ジーロズ ヒル インターナショナル リサーチ センター シンジェンタ リミテッド内
(72)発明者　ウォーリー ルイーザ
イギリス アールジー４２ ６イーワイ バークシャー ブラックネル シンジェンタ ジーロズ ヒル インターナショナル リサーチ センター シンジェンタ リミテッド内
(72)発明者　モリス ジェームス アラン
イギリス アールジー４２ ６イーワイ バークシャー ブラックネル シンジェンタ ジーロズ ヒル インターナショナル リサーチ センター シンジェンタ リミテッド内
(72)発明者　エメット エドワード ジョン
イギリス アールジー４２ ６イーワイ バークシャー ブラックネル シンジェンタ ジーロズ ヒル インターナショナル リサーチ センター シンジェンタ リミテッド内
(72)発明者　セデン ピーター ティモシー
イギリス アールジー４２ ６イーワイ バークシャー ブラックネル シンジェンタ ジーロズ ヒル インターナショナル リサーチ センター シンジェンタ リミテッド内

Ｆターム（参考）　4H011　AB01 BA03 BA06 BB09 BB10 BB11 BC03 BC07 BC16 BC18
BC19 BC20 DA02 DA04 DA05 DA15 DA16 DH10 DH14