

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号
特許第7083851号
(P7083851)

(45)発行日 令和4年6月13日(2022.6.13)

(24)登録日 令和4年6月3日(2022.6.3)

(51)国際特許分類

F I

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/12

C S P

A 0 1 N 43/80 (2006.01)

A 0 1 N 43/80

1 0 1

A 0 1 P 13/00 (2006.01)

A 0 1 P 13/00

A 0 1 G 7/06 (2006.01)

A 0 1 G 7/06

A

A 0 1 M 21/04 (2006.01)

A 0 1 M 21/04

C

請求項の数 22 (全151頁)

(21)出願番号 特願2019-568349(P2019-568349)

(86)(22)出願日 平成30年6月11日(2018.6.11)

(65)公表番号 特表2020-523346(P2020-523346
A)

(43)公表日 令和2年8月6日(2020.8.6)

(86)国際出願番号 PCT/EP2018/065333

(87)国際公開番号 WO2018/228985

(87)国際公開日 平成30年12月20日(2018.12.20)

審査請求日 令和3年6月9日(2021.6.9)

(31)優先権主張番号 17175777.6

(32)優先日 平成29年6月13日(2017.6.13)

(33)優先権主張国・地域又は機関
欧州特許庁(EP)

(73)特許権者 313006625

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

(73)特許権者 507203353

バイエル・クロップサイエンス・アクチ
エンゲゼルシャフト
ドイツ国、4 0 7 8 9・モンハイム・ア
ム・ライン、アルフレート・ノベル・シ
ュトラッセ・5 0

(74)代理人 100114188

弁理士 小野 誠

(74)代理人 100119253

弁理士 金山 賢教

最終頁に続く

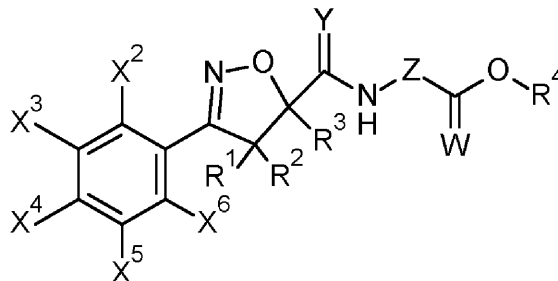
(54)【発明の名称】 除草活性を示すテトラヒドロ及びジヒドロフランカルボン酸及びエステル of 3 - フェニル
イソオキサゾリン - 5 - カルボキサミド類

(57)【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (I)

【化 1】



(I),

〔式中、

R¹ 及び R² は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素若しくはシアノを表すか、
又は、(C₁ - C₃) - アルキル若しくは (C₁ - C₃) - アルコキシ [ここで、これらは、そ
れぞれ、フッ素、塩素、臭素及びシアノからなる群から選択される m 個のラジカルで置換
されている] を表し；R³ は、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₃ - C₅) - シクロアルキル、(C₂ - C₄)

- アルケニル、(C₂ - C₄) - アルキニル又は(C₁ - C₄) - アルコキシ [ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、(C₁ - C₄) - アルコキシ及びヒドロキシからなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている] を表し；

R⁴ は、水素を表すか、

又は、

(C₁ - C₁₂) - アルキル、(C₃ - C₇) - シクロアルキル、(C₃ - C₇) - シクロアルキル - (C₁ - C₈) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、(C₅ - C₆) - シクロアルケニル若しくは(C₂ - C₈) - アルキニル [ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、(C₁ - C₆) - アルコキシ、ヒドロキシ及びアリールからなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている] を表し；

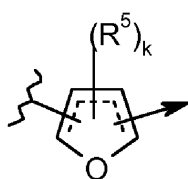
10

Y は、酸素又は硫黄を表し；

W は、酸素又は硫黄を表し；

Z は、基 R⁵ から選択される k 個のラジカルで置換されている完全飽和又は部分的飽和のフラン環

【化 2】



Z

20

[ここで、矢印は、いずれの場合にも、式 (I) の基 C = W への結合を表している]

を表し；

R⁵ は、フッ素、塩素、シアノ若しくはCO₂R⁷を表すか、

又は、

(C₁ - C₂) - アルキル若しくは(C₁ - C₂) - アルコキシ [ここで、これらは、それぞれ、フッ素及び塩素からなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている] を表し；

30

X²、X⁴及びX⁶は、互いに独立して、それぞれ、水素、フッ素、塩素、臭素若しくはシアノを表すか、

又は、

(C₁ - C₂) - アルキル [ここで、該アルキルは、いずれの場合にも、フッ素、塩素、臭素及び(C₁ - C₂) - アルコキシからなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている] を表し；

X³及びX⁵は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、S(O)_nR⁶若しくはCO₂R⁷を表すか、

又は、

(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₃ - C₄) - シクロアルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル若しくは(C₂ - C₃) - アルキニル [ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素及び臭素からなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている] を表し；

40

R⁶ は、(C₁ - C₂) - アルキル又は(C₃ - C₄) - シクロアルキル [ここで、これらは、それぞれ、フッ素及び塩素からなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている] を表し；

R⁷ は、水素を表すか、

又は、

(C₁ - C₃) - アルキル若しくは(C₃ - C₅) - シクロアルキル [ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素及び(C₁ - C₂) - アルコキシからなる群から選択されるm

50

個のラジカルで置換されている] を表し ;

k は、連続数 0、1 又は 2 を表し ;

m は、連続数 0、1、2、3、4 又は 5 を表し ; 及び、

n は、連続数 0、1 又は 2 を表す]

で表される 3 - フェニルイソオキサゾリン - 5 - カルボキサミド又は - 5 - チオアミド及びその農薬として許容される塩。

【請求項 2】

R¹ 及び R² は、互いに独立して、それぞれ、水素、フッ素、塩素若しくはシアノを表すか、

又は、

メチル若しくはメトキシ [ここで、これらは、それぞれ、フッ素及び塩素からなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている] を表す ;

請求項 1 に記載の一般式 (I) で表される化合物。

【請求項 3】

R³ は、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₃ - C₄) - シクロアルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル、(C₂ - C₃) - アルキニル又は (C₁ - C₃) - アルコキシ [ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、(C₁ - C₂) - アルコキシ及びヒドロキシからなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている] を表す ;

請求項 1 又は 2 に記載の一般式 (I) で表される化合物。

【請求項 4】

R⁴ は、水素を表すか、

又は、

(C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、(C₅ - C₆) - シクロアルケニル若しくは (C₂ - C₆) - アルキニル [ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、(C₁ - C₄) - アルコキシ、ヒドロキシ及びアリアルからなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている] を表す ;

請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の一般式 (I) で表される化合物。

【請求項 5】

Y 及び W は、酸素を表す ;

請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の一般式 (I) で表される化合物。

【請求項 6】

Z は、基 Z - 1 ~ 基 Z - 33 を表し、ここで、Z - 1 ~ Z - 33 は、下記意味 :

10

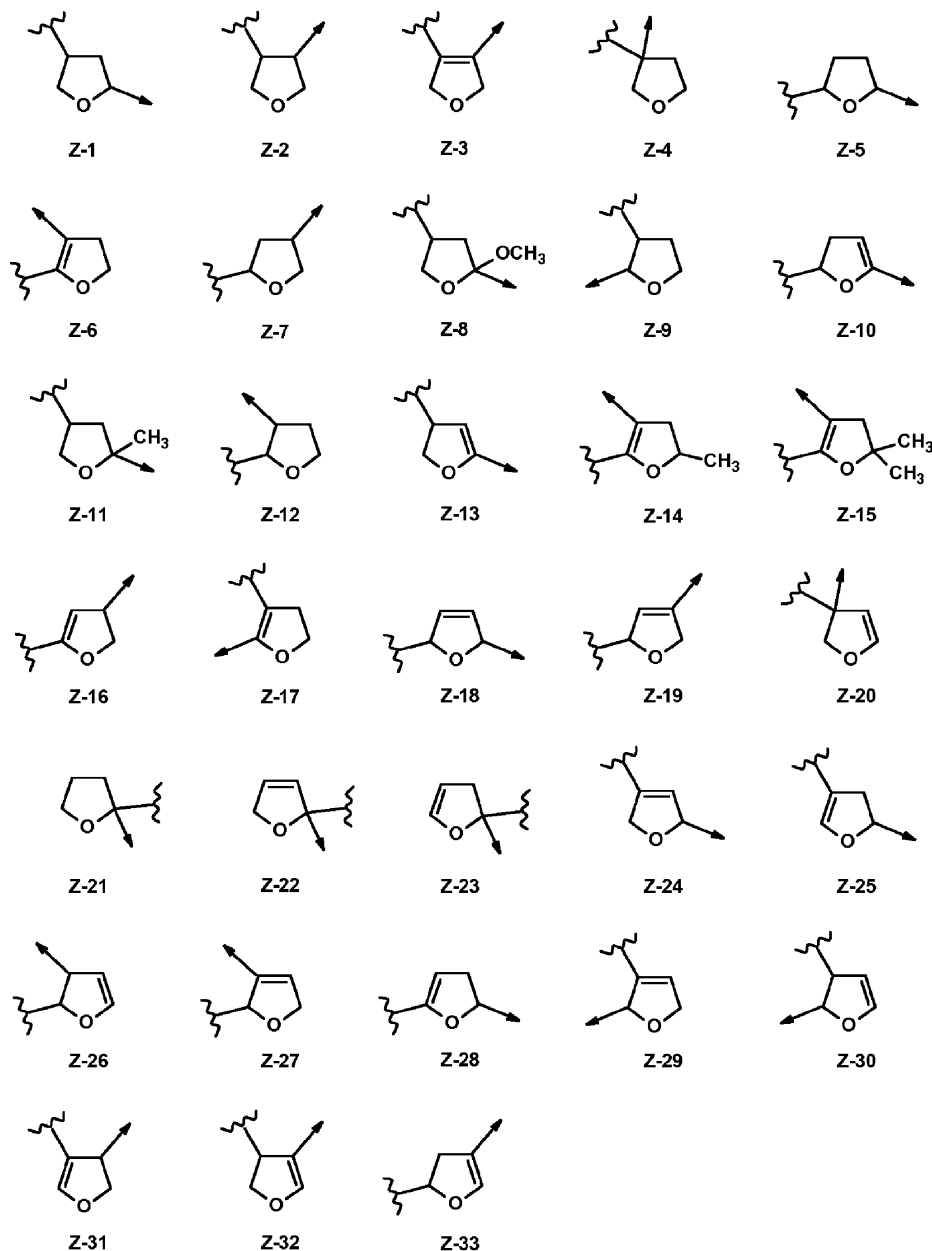
20

30

40

50

【化3】



10

20

30

〔ここで、矢印は、いずれの場合にも、式(I)の基C = Wへの結合を表している〕
を有している；

請求項1～5のいずれかに記載の一般式(I)で表される化合物。

【請求項7】

R⁵は、フッ素、塩素、シアノ、CO₂H、CO₂CH₃若しくはCO₂CH₂CH₃を表すか、

40

又は、

(C₁-C₂)-アルキル若しくは(C₁-C₂)-アルコキシ〔ここで、これらは、それぞれ、フッ素及び塩素からなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている〕を表す；

請求項1～6のいずれかに記載の一般式(I)で表される化合物。

【請求項8】

X²、X⁴及びX⁶は、互いに独立して、それぞれ、水素、フッ素、塩素、臭素若しくはシアノを表すか、

又は、

50

メチル若しくはメトキシ [ここで、これらは、それぞれ、フッ素及び塩素からなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている] を表す；

請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の一般式 (I) で表される化合物。

【請求項 9】

X^3 及び X^5 は、互いに独立して、それぞれ、水素、フッ素、塩素、臭素、ヒドロキシ若しくはシアノを表すか、

又は、

($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_3 - C_4$) - シクロアルキル、($C_2 - C_3$) - アルケニル若しくは ($C_2 - C_3$) - アルキニル [ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素及び臭素からなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている] を表す；

10

請求項 1 ~ 8 のいずれかに記載の一般式 (I) で表される化合物。

【請求項 10】

R^7 は、水素を表すか、

又は、

($C_1 - C_3$) - アルキル [ここで、これは、それぞれ、フッ素及び塩素からなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている] を表す；

請求項 1 ~ 9 のいずれかに記載の一般式 (I) で表される化合物。

【請求項 11】

連続数 m は、0、1、2 又は 3 である；

20

請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の一般式 (I) で表される化合物。

【請求項 12】

R^1 及び R^2 は、それぞれ、水素を表し；

R^3 は、($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_3 - C_4$) - シクロアルキル、($C_2 - C_3$) - アルケニル、($C_2 - C_3$) - アルキニル又は ($C_1 - C_3$) - アルコキシ [ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、($C_1 - C_2$) - アルコキシ及びヒドロキシからなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている] を表し；

R^4 は、水素を表すか、

又は、

($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、($C_3 - C_6$) - シクロアルキル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_2 - C_6$) - アルケニル、($C_5 - C_6$) - シクロアルケニル若しくは ($C_2 - C_6$) - アルキニル [ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、ヒドロキシ及びアールルからなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている] を表し；

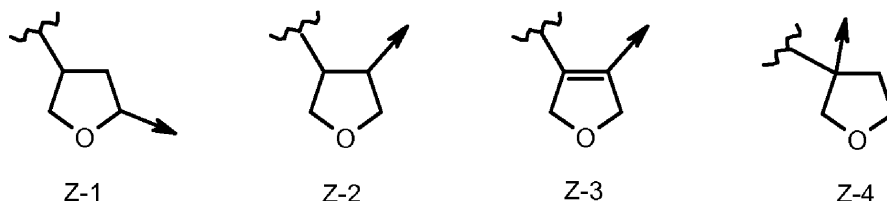
30

Y は、酸素を表し；

W は、酸素を表し；

Z は、基 $Z-1$ ~ 基 $Z-4$ を表し、ここで、 $Z-1$ ~ $Z-4$ は、下記意味：

【化 4】



40

[ここで、矢印は、いずれの場合にも、式 (I) の基 $C = W$ への結合を表している] を有しており；

X^2 、 X^4 及び X^6 は、互いに独立して、水素又はフッ素を表し；

X^3 及び X^5 は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヒドロキシ若しくはシアノを表すか、

50

又は、

(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₃ - C₄) - シクロアルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル若しくは(C₂ - C₃) - アルキニル[ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素及び臭素からなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている]を表し；及び、

mは、連続数0、1、2又は3を表す；

請求項1～11のいずれかに記載の一般式(I)で表される化合物。

【請求項13】

除草剤組成物又は植物成長調節剤組成物であって、請求項1～12のいずれかに記載の一般式(I)で表される少なくとも1種類の化合物又はその塩を含んでいることを特徴とする、前記除草剤組成物又は植物成長調節剤組成物。

10

【請求項14】

さらに製剤助剤を含んでいる、請求項13に記載の除草剤組成物。

【請求項15】

殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、殺菌剤、葉害軽減剤及び/又は成長調節剤の群から選択される少なくとも1種類のさらなる活性化合物を含んでいる、請求項13又は14に記載の除草剤組成物。

【請求項16】

葉害軽減剤を含んでいる、請求項14又は15に記載の除草剤組成物。

【請求項17】

前記葉害軽減剤が、メフェンピル - ジエチル、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、ベノキサコル及びジクロルミドからなる群から選択される、請求項16に記載の除草剤組成物。

20

【請求項18】

望ましくない植物を防除する方法であって、有効量の請求項1～12のいずれかに記載の式(I)で表される少なくとも1種類の化合物又は請求項13～17のいずれかに記載の除草剤組成物を、当該植物に施用すること又は当該望ましくない植生の生育環境に施用することを特徴とする、前記方法。

【請求項19】

望ましくない植物を防除するための、請求項1～12のいずれかに記載の式(I)で表される化合物又は請求項13～17のいずれかに記載の除草剤組成物の使用。

30

【請求項20】

式(I)で表される化合物を有用な植物の作物の中の望ましくない植物を防除するために使用することを特徴とする、請求項19に記載の使用。

【請求項21】

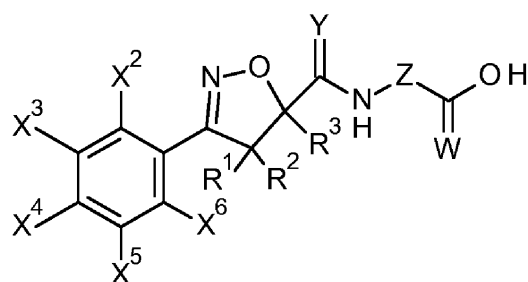
前記有用な植物が有用なトランスジェニック植物であることを特徴とする、請求項20に記載の使用。

【請求項22】

式(II)

【化5】

40



(II)

[式中、ラジカルX₂、X₃、X₄、X₅、X₆、R₁、R₂、R₃、Y、Z及びWは、

50

請求項 1 ~ 12 に従って定義される]

で表される化合物及びその農薬として許容される塩。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

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

【0002】

特に、本発明は、置換されているテトラヒドロ - 及びジヒドロフランカルボン酸及びエステルの 3 - フェニルイソオキサゾリン - 5 - カルボキサミド類及び - 5 - チオアミド類、それらを調製する方法、並びに、それらの除草剤としての使用に関する。

10

【背景技術】

【0003】

WO 1995 / 014681A1、WO 1995 / 014680A1、WO 2008 / 035315A1、WO 2005 / 051931A1 及び WO 2005 / 021515A1 には、それぞれ、とりわけ、フェニル環の 3 位及び 4 位においてアルコキシラジカルで置換されている 3 - フェニルイソオキサゾリン - 5 - カルボキサミド類が記載されている。WO 1998 / 057937A1 には、とりわけ、フェニル環の 4 位がアルコキシラジカルで置換されている化合物が記載されている。WO 2006 / 016237A1 には、とりわけ、フェニル環がアミドラジカルで置換されている化合物が記載されている。上記文献に記載されている化合物は、これらの文献の中で、薬理学的に活性であると開示されている。

20

【0004】

WO 2005 / 021516A1 には、薬理学的に活性な化合物としての 3 - (([3 - (3 - tert - ブチルフェニル) - 5 - エチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル] カルボニル) アミノ) - 5 - フルオロ - 4 - オキソペンタン酸及び 3 - (([3 - (3 - tert - ブチルフェニル) - 5 - イソプロピル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル] カルボニル) アミノ) - 5 - フルオロ - 4 - オキソペンタン酸が開示されている。

【0005】

DE 4026018A1、EP 0520371A2 及び DE 4017665 には、イソオキサゾリン環の 5 位に水素原子を有している 3 - フェニルイソオキサゾリン - 5 - カルボキサミド類が開示されている。これらの化合物は、それらの中で、農薬的に活性な薬害軽減剤として、即ち、作物植物に対する除草剤の望ましくない除草作用を排除する化合物として、記載されている。これらの化合物の除草活性については、開示されていない。本出願よりも早い優先日を有するが本出願の優先日にはまだ開示されていない欧州特許出願第 10170238 号には、除草活性及び殺菌活性を示す、イソオキサゾリン環の 5 位に水素原子を有する 3 - フェニルイソオキサゾリン - 5 - カルボキサミド類及び 3 - フェニルイソオキサゾリン - 5 - チオアミド類が開示されている。「Monatshefte Chemie (2010) 141, 461」及び「Letters in Organic Chemistry (2010), 7, 502」にも、イソオキサゾリン環の 5 位に水素原子を有する 3 - フェニルイソオキサゾリン - 5 - カルボキサミド類が開示されている。記載されている化合物の一部に関して、殺菌作用は開示されているが、除草作用は開示されていない。

30

40

【0006】

WO 2014 / 048827 には、3 - フェニルイソオキサゾリン - 5 - カルボン酸類、- 5 - カルボン酸エステル類、- 5 - カルバルデヒド類及び - 5 - ニトリル類の除草作用が記載されている。

【0007】

WO 2014 / 048853 には、除草作用及び殺菌作用を示す、3 位にヘテロ環を有す

50

るイソオキサゾリン - 5 - カルボキサミド類及び - 5 - チオアミド類が開示されている。

【0008】

WO2014/048940には、3位に特定のヘテロ環としてキノロンを有している、殺菌活性を示すイソオキサゾリンカルボキサミド類が開示されている。

【0009】

WO2014/048882には、5位に特定のラジカルとしてアルコキシを有するイソオキサゾリンカルボキサミド類が開示されている。

【0010】

WO2012/130798には、除草活性及び殺菌活性を示す、置換されているヘテロ環の3 - フェニルイソオキサゾリン - 5 - カルボキサミド類及び - 5 - チオアミド類が記載されている。

10

【0011】

これら既知化合物の除草活性（特に、低施用量における除草活性）及び／又はそれらの作物植物との適合性は、依然として改善する価値を有している。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0012】

【文献】WO1995/014681A1

WO1995/014680A1

WO2008/035315A1

WO2005/051931A1

WO2005/021515A1

WO1998/057937A1

WO2006/016237A1

WO2005/021516A1

DE4026018A1

EP0520371A2

DE4017665

欧州特許出願第10170238号

WO2014/048827

WO2014/048853

WO2014/048940

WO2014/048882

WO2012/130798

【非特許文献】

【0013】

【文献】Monatshefte Chemie (2010) 141, 461

Letters in Organic Chemistry (2010), 7, 502

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0014】

上述の理由により、作物植物の中で選択的に使用するための又は非農耕地で使用するための強力な除草剤及び／又は植物成長調節剤が依然として求められており、ここで、これらの活性成分は、好ましくは、施用においてさらなる有利な特性、例えば、作物植物との改善された適合性などを有しているべきである。

【0015】

従って、本発明の目的は、比較的低い施用量においてさえ経済的に重要な有害植物に対して高い効果を示し、且つ、作物植物の中で選択的に使用することが可能な、好ましくは有害植物に対して良好な活性を有して作物植物の中で選択的に使用することが可能な、及び、同時に、好ましくは作物植物との良好な適合性を示す、除草活性を有する化合物（除

50

草剤)を提供することである。好ましくは、これらの除草性化合物は、広い範囲のイネ科雑草に対して特に効果的で有効であるべきであり、及び、好ましくは、多くの種類の雑草に対しても良好な活性を示すべきである。

【0016】

式(I)で表される多くの化合物は、除草作用に加えて、殺菌作用も示すが、その殺菌作用はあまり顕著ではない。

【課題を解決するための手段】

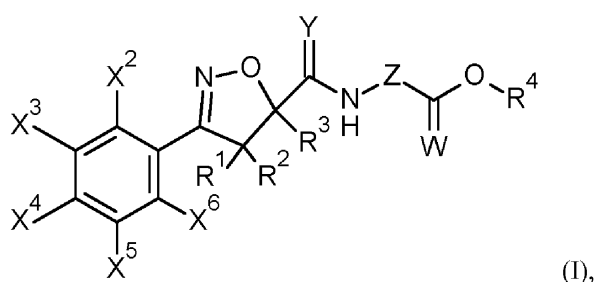
【0017】

驚くべきことに、以下で定義されている式(I)で表されるテトラヒドロ-及びジヒドロフランカルボン酸及びエステル、3-フェニルイソキサゾリン-5-カルボキサミド並びにそれらの塩が、経済学的に重要な広い範囲の単子葉及び双子葉の1年生有害植物に対して優れた除草活性を示すことが見いだされた。

【0018】

従って、本発明は、一般式(I)

【化1】



【0019】

〔式中、

R¹及びR²は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素若しくはシアノを表すか、又は、

(C₁-C₃)-アルキル若しくは(C₁-C₃)-アルコキシ[ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素及びシアノからなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている]を表し；

R³は、(C₁-C₄)-アルキル、(C₃-C₅)-シクロアルキル、(C₂-C₄)-アルケニル、(C₂-C₄)-アルキニル又は(C₁-C₄)-アルコキシ[ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、(C₁-C₄)-アルコキシ及びヒドロキシからなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている]を表し；

R⁴は、水素を表すか、

又は、

(C₁-C₁₂)-アルキル、(C₃-C₇)-シクロアルキル、(C₃-C₇)-シクロアルキル-(C₁-C₈)-アルキル、(C₂-C₈)-アルケニル、(C₅-C₆)-シクロアルケニル若しくは(C₂-C₈)-アルキニル[ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、(C₁-C₆)-アルコキシ、ヒドロキシ及びアリアルからなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている]を表し；

Yは、酸素又は硫黄を表し；

Wは、酸素又は硫黄を表し；

Zは、基R⁵のk個のラジカルで置換されている完全飽和又は部分的飽和のフラン環

10

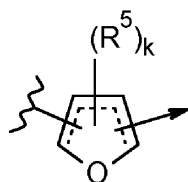
20

30

40

50

【化2】



Z

【0020】

10

[ここで、矢印は、いずれの場合にも、式(I)の基C = Wへの結合を表している]を表し；

R⁵は、フッ素、塩素、シアノ若しくはCO₂R⁷を表すか、

又は、

(C₁ - C₂) - アルキル若しくは(C₁ - C₂) - アルコキシ[ここで、これらは、それぞれ、フッ素及び塩素からなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている]を表し；

X²、X⁴及びX⁶は、互いに独立して、それぞれ、水素、フッ素、塩素、臭素若しくはシアノを表すか、

又は、

20

(C₁ - C₂) - アルキル[ここで、該アルキルは、いずれの場合にも、フッ素、塩素、臭素及び(C₁ - C₂) - アルコキシからなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている]を表し；

X³及びX⁵は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、S(O)_nR⁶若しくはCO₂R⁷を表すか、

又は、

(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₃ - C₄) - シクロアルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル若しくは(C₂ - C₃) - アルキニル[ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素及び臭素からなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている]を表し；

30

R⁶は、(C₁ - C₂) - アルキル又は(C₃ - C₄) - シクロアルキル[ここで、これらは、それぞれ、フッ素及び塩素からなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている]を表し；

R⁷は、水素を表すか、

又は、

(C₁ - C₃) - アルキル若しくは(C₃ - C₅) - シクロアルキル[ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素及び(C₁ - C₂) - アルコキシからなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている]を表し；

kは、連続数0、1又は2を表し；

mは、連続数0、1、2、3、4又は5を表し；及び、

40

nは、連続数0、1又は2を表す]

で表される化合物及びその農薬として許容される塩を提供する。

【0021】

アルキルは、いずれの場合にも指定されている数の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖の飽和ヒドロカルビルラジカル、例えば、C₁ - C₆ - アルキル、例えば、メチル、エチル、プロピル、1 - メチルエチル、ブチル、1 - メチルプロピル、2 - メチルプロピル、1, 1 - ジメチルエチル、ペンチル、1 - メチルブチル、2 - メチルブチル、3 - メチルブチル、2, 2 - ジメチルプロピル、1 - エチルプロピル、ヘキシル、1, 1 - ジメチルプロピル、1, 2 - ジメチルプロピル、1 - メチルペンチル、2 - メチルペンチル、3 - メチルペンチル、4 - メチルペンチル、1, 1 - ジメチルブチル、1, 2 - ジメチルブチル、

50

1, 3 - ジメチルブチル、2, 2 - ジメチルブチル、2, 3 - ジメチルブチル、3, 3 - ジメチルブチル、1 - エチルブチル、2 - エチルブチル、1, 1, 2 - トリメチルプロピル、1, 2, 2 - トリメチルプロピル、1 - エチル - 1 - メチルプロピル及び1 - エチル - 2 - メチルプロピルなどを意味する。

【0022】

ハロゲンで置換されているアルキルは、直鎖又は分枝鎖のアルキル基において、それらの基内の水素原子の一部又は全てがハロゲン原子で置き換えられ得るもの、例えば、C₁ - C₂ - ハロアルキル、例えば、クロロメチル、ブromoメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、1 - クロロエチル、1 - ブromoエチル、1 - フルオロエチル、2 - フルオロエチル、2, 2 - ジフルオロエチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2 - クロロ - 2 - フルオロエチル、2 - クロロ, 2 - ジフルオロエチル、2, 2 - ジクロロ - 2 - フルオロエチル、2, 2, 2 - トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル及び1, 1, 1 - トリフルオロプロパ - 2 - イルなどを意味する。

【0023】

アルケニルは、いずれの場合にも指定されている数の炭素原子及びいずれかの位置に1つの二重結合を有する直鎖又は分枝鎖の不飽和ヒドロカルビルラジカル、例えば、C₂ - C₆ - アルケニル、例えば、エテニル、1 - プロペニル、2 - プロペニル、1 - メチルエテニル、1 - ブテニル、2 - ブテニル、3 - ブテニル、1 - メチル - 1 - プロペニル、2 - メチル - 1 - プロペニル、1 - メチル - 2 - プロペニル、2 - メチル - 2 - プロペニル、1 - ペンテニル、2 - ペンテニル、3 - ペンテニル、4 - ペンテニル、1 - メチル - 1 - ブテニル、2 - メチル - 1 - ブテニル、3 - メチル - 1 - ブテニル、1 - メチル - 2 - ブテニル、2 - メチル - 2 - ブテニル、3 - メチル - 2 - ブテニル、1 - メチル - 3 - ブテニル、2 - メチル - 3 - ブテニル、3 - メチル - 3 - ブテニル、1, 1 - ジメチル - 2 - プロペニル、1, 2 - ジメチル - 1 - プロペニル、1, 2 - ジメチル - 2 - プロペニル、1 - エチル - 1 - プロペニル、1 - エチル - 2 - プロペニル、1 - ヘキセニル、2 - ヘキセニル、3 - ヘキセニル、4 - ヘキセニル、5 - ヘキセニル、1 - メチル - 1 - ペンテニル、2 - メチル - 1 - ペンテニル、3 - メチル - 1 - ペンテニル、4 - メチル - 1 - ペンテニル、1 - メチル - 2 - ペンテニル、2 - メチル - 2 - ペンテニル、3 - メチル - 2 - ペンテニル、4 - メチル - 2 - ペンテニル、1 - メチル - 3 - ペンテニル、2 - メチル - 3 - ペンテニル、3 - メチル - 3 - ペンテニル、4 - メチル - 3 - ペンテニル、1 - メチル - 4 - ペンテニル、2 - メチル - 4 - ペンテニル、3 - メチル - 4 - ペンテニル、4 - メチル - 4 - ペンテニル、1, 1 - ジメチル - 2 - ブテニル、1, 1 - ジメチル - 3 - ブテニル、1, 2 - ジメチル - 1 - ブテニル、1, 2 - ジメチル - 2 - ブテニル、1, 2 - ジメチル - 3 - ブテニル、1, 3 - ジメチル - 1 - ブテニル、1, 3 - ジメチル - 2 - ブテニル、1, 3 - ジメチル - 3 - ブテニル、2, 2 - ジメチル - 3 - ブテニル、2, 3 - ジメチル - 1 - ブテニル、2, 3 - ジメチル - 2 - ブテニル、2, 3 - ジメチル - 3 - ブテニル、3, 3 - ジメチル - 1 - ブテニル、3, 3 - ジメチル - 2 - ブテニル、1 - エチル - 1 - ブテニル、1 - エチル - 2 - ブテニル、1 - エチル - 3 - ブテニル、2 - エチル - 1 - ブテニル、2 - エチル - 2 - ブテニル、2 - エチル - 3 - ブテニル、1, 1, 2 - トリメチル - 2 - プロペニル、1 - エチル - 1 - メチル - 2 - プロペニル、1 - エチル - 2 - メチル - 1 - プロペニル及び1 - エチル - 2 - メチル - 2 - プロペニルなどを意味する。

【0024】

アルキニルは、いずれの場合にも指定されている数の炭素原子及びいずれかの位置に1つの三重結合を有する直鎖又は分枝鎖のヒドロカルビルラジカル、例えば、C₂ - C₆ - アルキニル、例えば、エチニル、1 - プロピニル、2 - プロピニル(又は、プロパルギル)、1 - ブチニル、2 - ブチニル、3 - ブチニル、1 - メチル - 2 - プロピニル、1 - ペンチニル、2 - ペンチニル、3 - ペンチニル、4 - ペンチニル、3 - メチル - 1 - ブチニル、1 - メチル - 2 - ブチニル、1 - メチル - 3 - ブチニル、2 - メチル - 3 - ブチニル、

1, 1 - ジメチル - 2 - プロピニル、1 - エチル - 2 - プロピニル、1 - ヘキシニル、2 - ヘキシニル、3 - ヘキシニル、4 - ヘキシニル、5 - ヘキシニル、3 - メチル - 1 - ペンチニル、4 - メチル - 1 - ペンチニル、1 - メチル - 2 - ペンチニル、4 - メチル - 2 - ペンチニル、1 - メチル - 3 - ペンチニル、2 - メチル - 3 - ペンチニル、1 - メチル - 4 - ペンチニル、2 - メチル - 4 - ペンチニル、3 - メチル - 4 - ペンチニル、1, 1 - ジメチル - 2 - ブチニル、1, 1 - ジメチル - 3 - ブチニル、1, 2 - ジメチル - 3 - ブチニル、2, 2 - ジメチル - 3 - ブチニル、3, 3 - ジメチル - 1 - ブチニル、1 - エチル - 2 - ブチニル、1 - エチル - 3 - ブチニル、2 - エチル - 3 - ブチニル及び1 - エチル - 1 - メチル - 2 - プロピニルなどを意味する。

【0025】

シクロアルキルは、好ましくは3～8個の環炭素原子を有する、炭素環式飽和環系、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルなどを意味する。置換されていてもよいシクロアルキルの場合、置換基を有する環式系が包含され、さらに、当該シクロアルキルラジカル上に二重結合を有する置換基（例えば、アルキリデン基、例えば、メチリデン）を有する環式系も包含される。

【0026】

置換されていてもよいシクロアルキルの場合、多環式脂肪族系、例えば、ビスクロ[1.1.0]ブタン - 1 - イル、ビスクロ[1.1.0]ブタン - 2 - イル、ビスクロ[2.1.0]ペンタン - 1 - イル、ビスクロ[2.1.0]ペンタン - 2 - イル、ビスクロ[2.1.0]ペンタン - 5 - イル、ビスクロ[2.2.1]ヘプタ - 2 - イル（ノルボルニル）、アダマンタン - 1 - イル及びアダマンタン - 2 - イルなども包含される。

【0027】

置換されているシクロアルキルの場合、スピロ環式脂肪族系、例えば、スピロ[2.2]ペンタ - 1 - イル、スピロ[2.3]ヘキサ - 1 - イル、及び、スピロ[2.3]ヘキサ - 4 - イル、3 - スピロ[2.3]ヘキサ - 5 - イルなども包含される。

【0028】

シクロアルケニルは、好ましくは4～8個の炭素原子を有する、非芳香族の部分的不飽和の炭素環式環系、例えば、1 - シクロブテニル、2 - シクロブテニル、1 - シクロペンテニル、2 - シクロペンテニル、3 - シクロペンテニル、又は、1 - シクロヘキセニル、2 - シクロヘキセニル、3 - シクロヘキセニル、1, 3 - シクロヘキサジエニル若しくは1, 4 - シクロヘキサジエニルなどを意味し、さらに、当該シクロアルケニルラジカル上に二重結合を有する置換基（例えば、アルキリデン基、例えば、メチリデン）も包含される。置換されていてもよいシクロアルケニルの場合、置換されているシクロアルキルに関する説明が相応するように当てはまる。

【0029】

アルコキシは、いずれの場合にも指定されている数の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖の飽和アルコキシラジカル、例えば、C₁ - C₆ - アルコキシ、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、1 - メチルエトキシ、ブトキシ、1 - メチルプロポキシ、2 - メチルプロポキシ、1, 1 - ジメチルエトキシ、ペントキシ、1 - メチルブトキシ、2 - メチルブトキシ、3 - メチルブトキシ、2, 2 - ジメチルプロポキシ、1 - エチルプロポキシ、ヘキソキシ、1, 1 - ジメチルプロポキシ、1, 2 - ジメチルプロポキシ、1 - メチルペントキシ、2 - メチルペントキシ、3 - メチルペントキシ、4 - メチルペントキシ、1, 1 - ジメチルブトキシ、1, 2 - ジメチルブトキシ、1, 3 - ジメチルブトキシ、2, 2 - ジメチルブトキシ、2, 3 - ジメチルブトキシ、3, 3 - ジメチルブトキシ、1 - エチルブトキシ、2 - エチルブトキシ、1, 1, 2 - トリメチルプロポキシ、1, 2, 2 - トリメチルプロポキシ、1 - エチル - 1 - メチルプロポキシ及び1 - エチル - 2 - メチルプロポキシなどを意味する。ハロゲンで置換されているアルコキシは、いずれの場合にも指定されている数の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖の飽和アルコキシラジカルにおいて、それらの基内の水素原子の一部又は全てが上記で特定されているハロゲン原子で置き換えられ得るもの、例えば、C₁ - C₂ - ハロアルコキシ、例えば、クロロメトキシ、プロモメ

10

20

30

40

50

トキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、1 - クロロエトキシ、1 - ブロモエトキシ、1 - フルオロエトキシ、2 - フルオロエトキシ、2, 2 - ジフルオロエトキシ、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、2 - クロロ - 2 - フルオロエトキシ、2 - クロロ - 1, 2 - ジフルオロエトキシ、2, 2 - ジクロロ - 2 - フルオロエトキシ、2, 2, 2 - トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ及び1, 1, 1 - トリフルオロプロパ - 2 - オキシなどを意味する。

【0030】

アリールは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ヒドロキシ、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₃ - C₄) - シクロアルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル及び(C₂ - C₃) - アルキニルからなる群から選択される0 ~ 5のラジカルで置換されていてもよいフェニルを意味する。

10

【0031】

用語「ハロゲン」は、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を意味する。該用語がラジカルに関して使用される場合、「ハロゲン」は、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を意味する。

【0032】

置換基の種類及びそれらが結合している方法に応じて、式(I)で表される化合物は、立体異性体として存在し得る。例えば、1以上の不斉に置換されている炭素原子及びノ又はスルホキシドが存在している場合、エナンチオマー及びジアステレオマーが生じ得る。立体異性体は、その調製において得られた混合物から、慣習的な分離方法によって、例えば、クロマトグラフ分離プロセスによって、得ることができる。光学的に活性な出発物質及びノ又は補助剤を用いる立体選択的反応を使用することによって、立体異性体を選択的に調製することも同様に可能である。

20

【0033】

本発明は、一般式(I)に包含されるが具体的には定義されていない全ての立体異性体及びそれらの混合物にも関する。しかしながら、以下の本文では、単純化を目的として、たとえ式(I)で表される化合物が純粋な化合物のみを意味するのではなく、適切な場合には種々の量の異性体化合物の混合物も意味すると理解される場合でも、常に、式(I)で表される化合物について言及する。

30

【0034】

式(I)で表される化合物は、上記で定義されている置換基の種類に応じて、酸性特性を有し、そして、塩を形成することができ、適切な場合には、内部塩を形成することもでき、あるいは、無機塩基若しくは有機塩基との付加体又は金属イオンとの付加体を形成することもできる。式(I)で表される化合物がヒドロキシル基、カルボキシル基又は酸性特性を誘導する別の基を有している場合、そのような化合物は、塩基と反応して、塩を生成することができる。適切な塩基は、例えば、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の水酸化物、炭酸塩、重炭酸塩、特に、ナトリウム、カリウム、マグネシウム及びカルシウムの水酸化物、炭酸塩、重炭酸塩、さらに、アンモニア、C₁ - C₄ - アルキル基を有する第1級アミン、第2級アミン及び第3級アミン、C₁ - C₄ - アルカノールのモノアルカノールアミン、ジアルカノールアミン及びトリアルカノールアミン、コリン及びクロロコリン、並びに、さらに、有機アミン、例えば、トリアルキルアミン、モルホリン、ピペリジン又はピリジンなどである。これらの塩は、当該酸性水素が農業上適切なカチオンで置き換えられている化合物、例えば、金属塩、特に、アルカリ金属塩若しくはアルカリ土類金属塩、特に、ナトリウム塩及びカリウム塩、又は、アンモニウム塩、有機アミンとの塩、又は、第4球アンモニウム塩、例えば、式[NR₄⁺R'₁R'₂R'₃R'₄]⁺〔式中、R ~ R'₁ ~ R'₄は、それぞれ、互いに独立して、有機ラジカル、特に、アルキル、アリール、アラルキル又はアルキルアリールを表す〕で表されるカチオンとの塩である。同様に適しているものは、アルキルスルホニウム塩及びアルキルスルホキソニウム塩、例えば、(C₁ - C₄) - トリアルキルスルホニウム塩及び(C₁ - C₄) - トリアルキルスルホキソニウム塩である。

40

50

【 0 0 3 5 】

式 (I) で表される化合物は、塩基性基 (例えば、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ピペリジノ、モルホリノ又はピリジノ) に適切な無機酸又は有機酸 (例えば、鉱酸、例えば、 HCl 、 HBr 、 H_2SO_4 、 H_3PO_4 若しくは HNO_3 、又は、有機酸、例えば、カルボン酸、例えば、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、シュウ酸、乳酸若しくはサリチル酸、又は、スルホン酸、例えば、*p*-トルエンスルホン酸) が付加することによって、塩を形成することができる。そのような場合、これらの塩は、当該酸の共役塩基をアニオンとして含んでいる。

【 0 0 3 6 】

脱プロトン化された形態で存在している適切な置換基 (例えば、スルホン酸又はカルボン酸) は、プロトン化され得る基 (例えば、アミノ基) と内部塩を形成することができる。

10

【 0 0 3 7 】

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

【 0 0 3 8 】

以下で特定されている全ての式において、置換基及び記号は、異なるように定義されていない限り、式 (I) で記載されている意味と同じ意味を有する。化学式の中の矢印は、当該分子の残部に結合している点を表している。

【 0 0 3 9 】

以下において、個々の置換基のそれぞれに関する好ましい定義、特に好ましい定義及び極めて特に好ましい定義について説明する。一般式 (I) の下記において特定されていないその他の置換基は、上記で与えられている定義を有する。

20

【 発明を実施するための形態 】

【 0 0 4 0 】

本発明の第 1 の実施形態によれば、

R^1 及び R^2 は、好ましくは、互いに独立して、それぞれ、水素、フッ素、塩素若しくはシアノを表すか、又は、メチル若しくはメトキシ [ここで、これらは、いずれの場合にも、フッ素及び塩素からなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている] を表す。

【 0 0 4 1 】

特に好ましくは、 R^1 及び R^2 は、それぞれ、水素を表す。

30

【 0 0 4 2 】

本発明の第 2 の実施形態によれば、

R^3 は、好ましくは、($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_3 - C_4$) - シクロアルキル、($C_2 - C_3$) - アルケニル、($C_2 - C_3$) - アルキニル又は ($C_1 - C_3$) - アルコキシ [ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、($C_1 - C_2$) - アルコキシ及びヒドロキシからなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている] を表す。

【 0 0 4 3 】

本発明の第 3 の実施形態によれば、

R^4 は、好ましくは、($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、($C_3 - C_6$) - シクロアルキル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_2 - C_6$) - アルケニル、($C_5 - C_6$) - シクロアルケニル又は ($C_2 - C_6$) - アルキニル [ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、ヒドロキシ及びアリールからなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている] を表す。

40

【 0 0 4 4 】

本発明の第 4 の実施形態によれば、

Y は、好ましくは、酸素を表す。

【 0 0 4 5 】

本発明の第 5 の実施形態によれば、

50

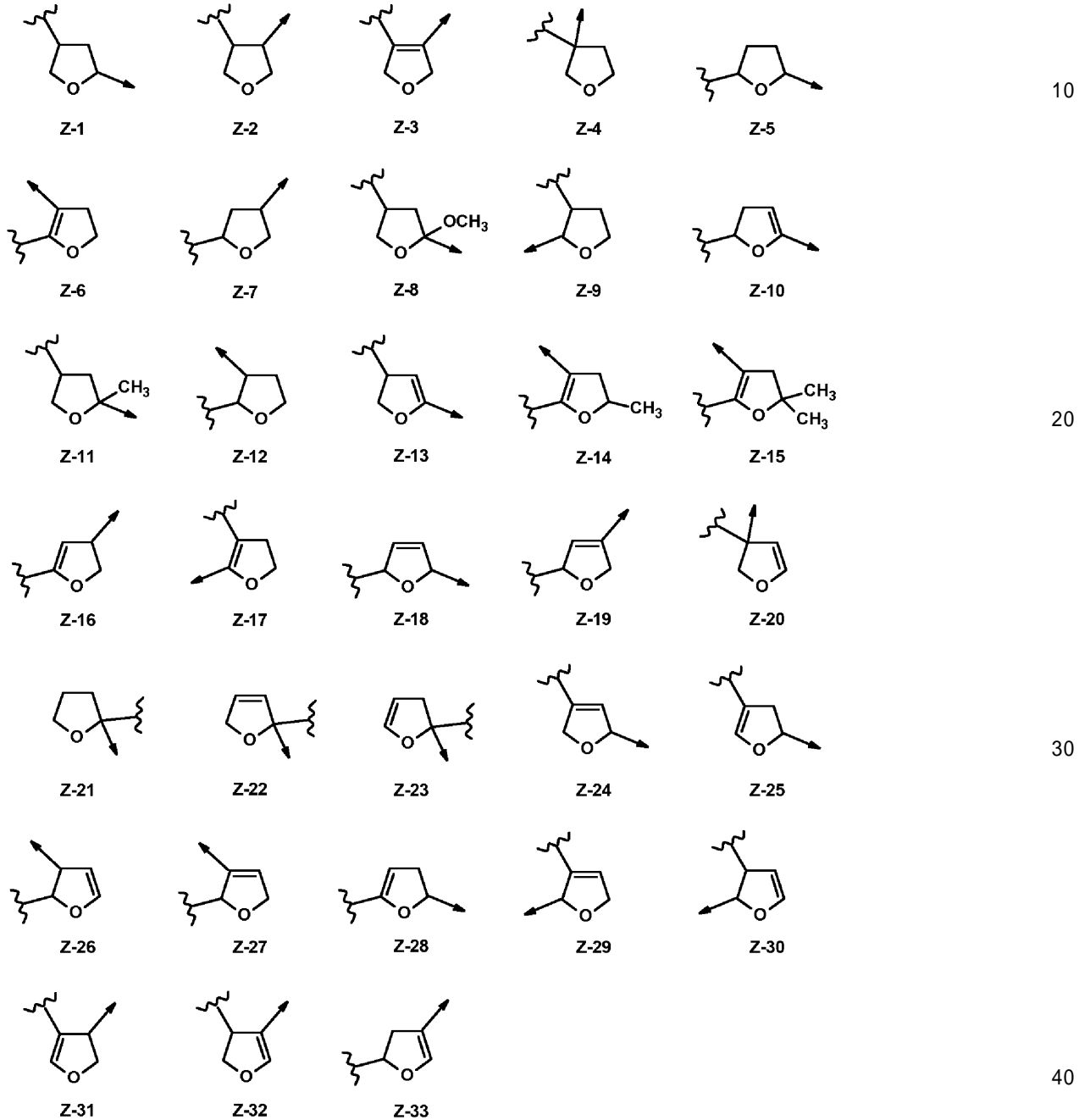
Wは、好ましくは、酸素を表す。

【 0 0 4 6 】

本発明の第 6 の実施形態によれば、

Zは、好ましくは、基 Z - 1 ~ 基 Z - 3 3 を表し、ここで、Z - 1 ~ Z - 3 3 は、下記意味：

【 化 3 】



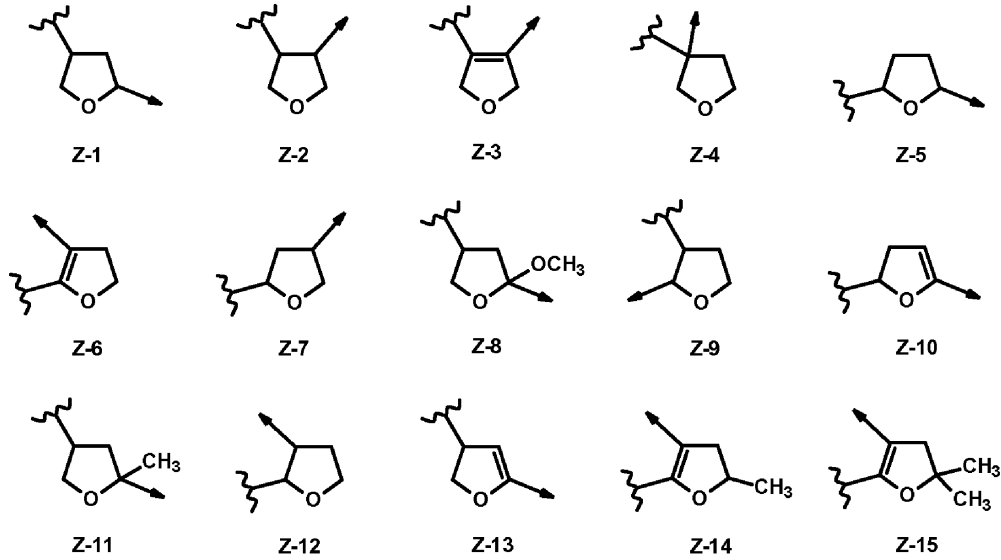
【 0 0 4 7 】

〔ここで、矢印は、いずれの場合にも、式 (I) の基 C = W への結合を表している〕
を有している。

【 0 0 4 8 】

特に好ましくは、Zは、基 Z - 1 ~ 基 Z - 1 5 を表し、ここで、Z - 1 ~ Z - 1 5 は、下記意味：

【化4】



10

【0049】

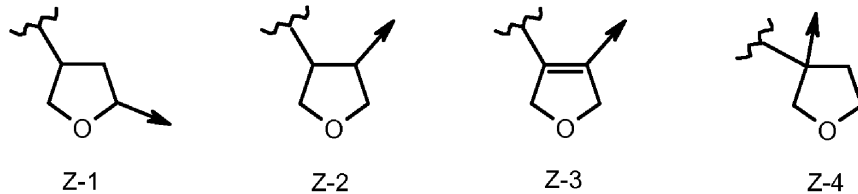
〔ここで、矢印は、いずれの場合にも、式(I)の基C = Wへの結合を表している〕

20

【0050】

最も好ましくは、Zは、Z - 1 ~ Z - 4

【化5】



30

【0051】

〔ここで、矢印は、いずれの場合にも、式(I)の基C = Wへの結合を表している〕

を表す。

【0052】

本発明の第7の実施形態によれば、

R⁵は、好ましくは、フッ素、塩素、シアノ、CO₂H、CO₂CH₃若しくはCO₂CH₂CH₃を表すか、又は、(C₁-C₂)-アルキル若しくは(C₁-C₂)-アルコキシ〔ここで、これらは、それぞれ、フッ素及び塩素からなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている〕を表す。

40

【0053】

本発明の第8の実施形態によれば、

X²、X⁴及びX⁶は、好ましくは、互いに独立して、それぞれ、水素、フッ素、塩素、臭素若しくはシアノを表すか、又は、メチル若しくはメトキシ〔ここで、これらは、それぞれ、フッ素及び塩素からなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている〕を表す。

【0054】

特に好ましくは、X²、X⁴及びX⁶は、互いに独立して、水素又はフッ素を表す。

【0055】

本発明の第9の実施形態によれば、

50

X³及びX⁵は、好ましくは、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヒドロキシ若しくはシアノを表すか、又は、(C₁-C₃)-アルキル、(C₁-C₃)-アルコキシ、(C₃-C₄)-シクロアルキル、(C₂-C₃)-アルケニル若しくは(C₂-C₃)-アルキニル[ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素及び臭素からなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている]を表す。

【0056】

本発明の第10の実施形態によれば、

R⁷は、好ましくは、水素を表すか、又は、(C₁-C₃)-アルキル[ここで、これらは、いずれの場合にも、フッ素及び塩素からなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている]を表す。

【0057】

本発明の第11の実施形態によれば、

mは、好ましくは、0、1、2又は3を表す。

【0058】

本発明に関連して、置換基R¹~R⁷、X²~X⁶、W、Y及びZ並びに連続数k、m及びnの個々の好ましい意味、個々の特に好ましい意味及び個々の最も好ましい意味は、必要に応じて互いに組み合わせることができる。

【0059】

このことは、本発明が一般式(I)[式中、例えば、置換基R¹は好まし定義を有し且つ置換基R²~R⁷は一般的な定義を有する、又は、置換基R²は好ましい定義を有し且つ置換基R³は特に好ましい定義若しくは極めて特に好ましい定義を有し且つ残りの置換基は一般的な定義を有する]で表される化合物を包含していることを意味する。

【0060】

置換基R¹~R⁷、X²~X⁶、W、Y及びZ並びに連続数k、m及びnに関して上記で与えられている定義のこれら組合せのうちの種類について、下記において例証として説明し、そして、それらは、それぞれ、さらなる実施形態として開示されている。

【0061】

本発明の第12の実施形態によれば、

R¹及びR²は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素若しくはシアノを表すか、又は、

(C₁-C₃)-アルキル若しくは(C₁-C₃)-アルコキシ[ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素及びシアノからなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている]を表し；

R³は、(C₁-C₄)-アルキル、(C₃-C₅)-シクロアルキル、(C₂-C₄)-アルケニル、(C₂-C₄)-アルキニル又は(C₁-C₄)-アルコキシ[ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、(C₁-C₄)-アルコキシ及びヒドロキシからなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている]を表し；

R⁴は、水素を表すか、

又は、

(C₁-C₆)-アルキル、(C₃-C₆)-シクロアルキル、(C₃-C₆)-シクロアルキル-(C₁-C₆)-アルキル、(C₂-C₆)-アルケニル、(C₅-C₆)-シクロアルケニル若しくは(C₂-C₆)-アルキニル[ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、(C₁-C₄)-アルコキシ、ヒドロキシ及びアールからなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている]を表し；

Yは、酸素を表し；

Wは、酸素を表し；

Zは、基Z-1~基Z-33を表し、ここで、Z-1~Z-33は、下記意味：

10

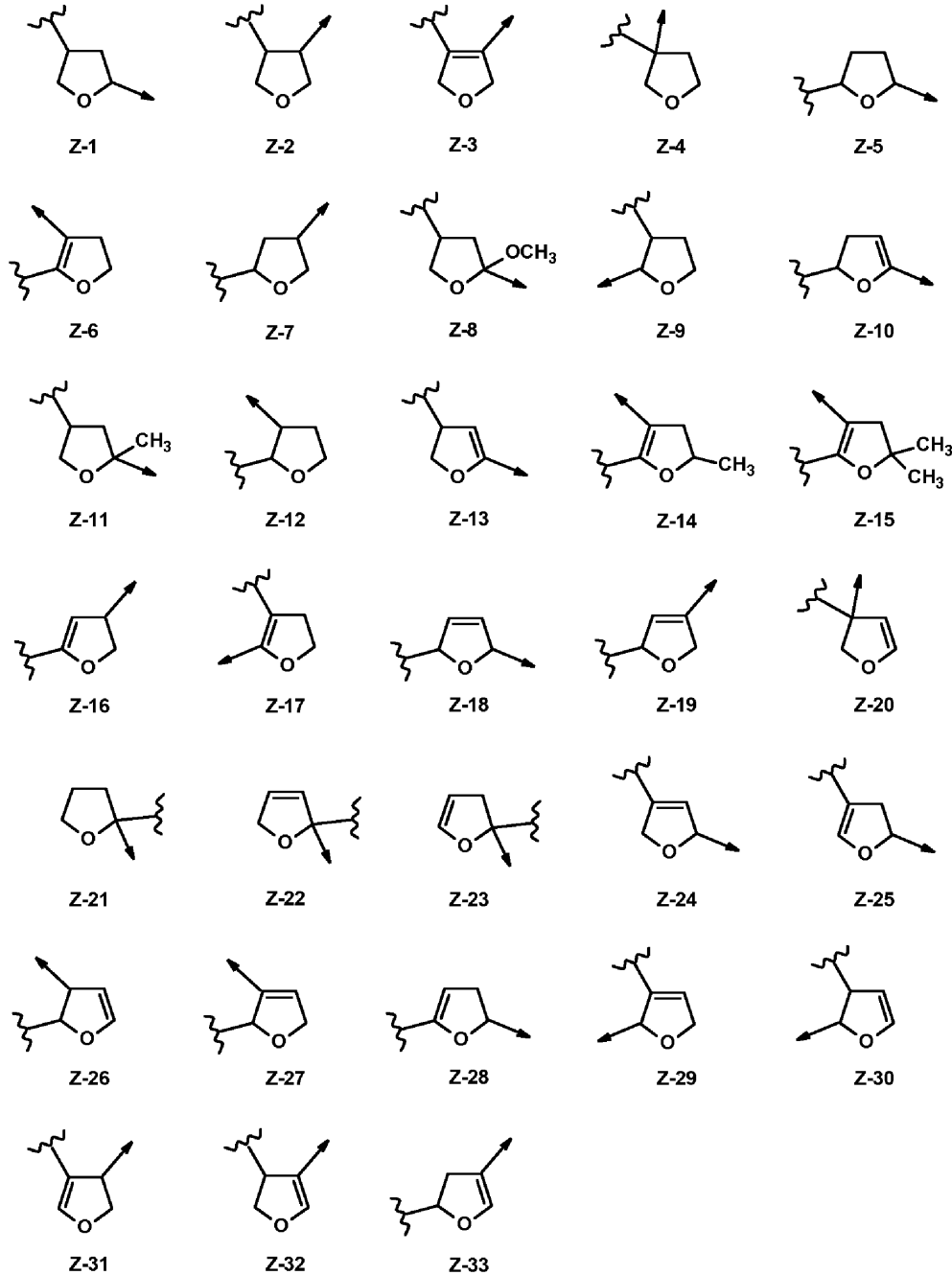
20

30

40

50

【化6】



10

20

30

【0062】

〔ここで、矢印は、いずれの場合にも、式(I)の基C = Wへの結合を表している〕

40

を有しており；

X²、X⁴及びX⁶は、互いに独立して、それぞれ、水素、フッ素、塩素、臭素若しくはシアノを表すか、

又は、

(C₁ - C₂) - アルキル〔ここで、該アルキルは、いずれの場合にも、フッ素、塩素、臭素及び(C₁ - C₂) - アルコキシからなる群から選択されるm個のラジカルで置換されている〕を表し；

X³及びX⁵は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、S(O)_nR⁶若しくはCO₂R⁷を表すか、

又は、

50

(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₃ - C₄) - シクロアルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル若しくは(C₂ - C₃) - アルキニル [ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素及び臭素からなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている] を表し；

R⁶ は、(C₁ - C₂) - アルキル又は(C₃ - C₄) - シクロアルキル [ここで、これらは、それぞれ、フッ素及び塩素からなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている] を表し；

R⁷ は、水素を表すか、

又は、

(C₁ - C₃) - アルキル若しくは(C₃ - C₅) - シクロアルキル [ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素及び(C₁ - C₂) - アルコキシからなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている] を表し；

m は、連続数 0、1、2 又は 3 を表し；及び、

n は、連続数 0、1 又は 2 を表す。

【0063】

本発明の第 13 の実施形態によれば、

R¹ 及び R² は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素若しくはシアノを表すか、

又は、

メチル若しくはメトキシ [ここで、これらは、それぞれ、フッ素及び塩素からなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている] を表し；

R³ は、(C₁ - C₃) - アルキル、(C₃ - C₄) - シクロアルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル、(C₂ - C₃) - アルキニル又は(C₁ - C₃) - アルコキシ [ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、(C₁ - C₂) - アルコキシ及びヒドロキシからなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている] を表し；

R⁴ は、水素を表すか、

又は、

(C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、(C₅ - C₆) - シクロアルケニル若しくは(C₂ - C₆) - アルキニル [ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、(C₁ - C₄) - アルコキシ、ヒドロキシ及びアリアルからなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている] を表し；

Y は、酸素を表し；

W は、酸素を表し；

Z は、基 Z - 1 ~ 基 Z - 15 を表し、ここで、Z - 1 ~ Z - 15 は、下記意味：

10

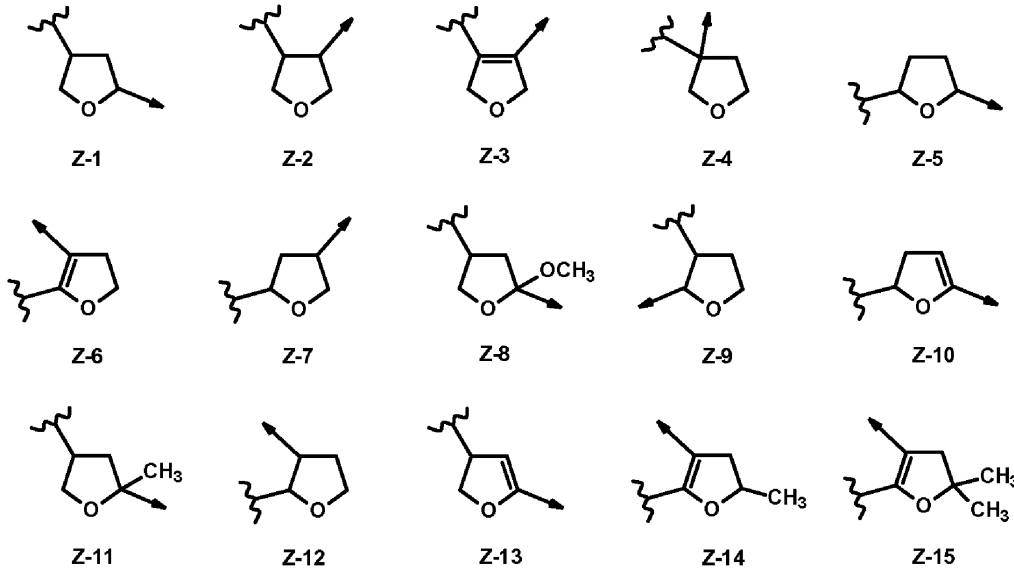
20

30

40

50

【化 7】



10

【0064】

〔ここで、矢印は、いずれの場合にも、式 (I) の基 $C = W$ への結合を表している〕

20

を有しており；

X^2 、 X^4 及び X^6 は、互いに独立して、それぞれ、水素、フッ素、塩素、臭素若しくはシアノを表すか、

又は、

メチル若しくはメトキシ〔ここで、これらは、それぞれ、フッ素及び塩素からなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている〕を表し；

X^3 及び X^5 は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ若しくはシアノを表すか、

又は、

($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_1 - C_3$) - アルコキシ、($C_3 - C_4$) - シクロアルキル、($C_2 - C_3$) - アルケニル若しくは ($C_2 - C_3$) - アルキニル〔ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素及び臭素からなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている〕を表し；及び、

30

m は、連続数 0、1、2 又は 3 を表す。

【0065】

本発明の第 14 の実施形態によれば、

R^1 及び R^2 は、それぞれ、水素を表し；

R^3 は、($C_1 - C_3$) - アルキル、($C_3 - C_4$) - シクロアルキル、($C_2 - C_3$) - アルケニル、($C_2 - C_3$) - アルキニル又は ($C_1 - C_3$) - アルコキシ〔ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、($C_1 - C_2$) - アルコキシ及びヒドロキシからなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている〕を表し；

40

R^4 は、水素を表すか、

又は、

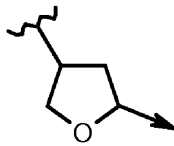
($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_3 - C_6$) - シクロアルキル、($C_3 - C_6$) - シクロアルキル - ($C_1 - C_6$) - アルキル、($C_2 - C_6$) - アルケニル、($C_5 - C_6$) - シクロアルケニル若しくは ($C_2 - C_6$) - アルキニル〔ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、($C_1 - C_4$) - アルコキシ、ヒドロキシ及びアリアルからなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている〕を表し；

Y は、酸素を表し；

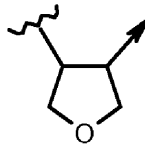
W は、酸素を表し；

50

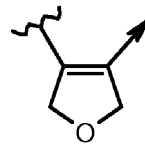
Zは、基 Z - 1 ~ 基 Z - 4 を表し、ここで、Z - 1 ~ Z - 4 は、下記意味：
【化 8】



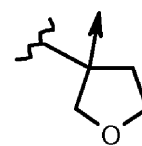
Z-1



Z-2



Z-3



Z-4

10

【0066】

〔ここで、矢印は、いずれの場合にも、式 (I) の基 C = W への結合を表している〕
を有しており；

X²、X⁴ 及び X⁶ は、互いに独立して、水素又はフッ素を表し；

X³ 及び X⁵ は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヒドロキシ若しくはシアノを表すか、

又は、

(C₁ - C₃) - アルキル、(C₁ - C₃) - アルコキシ、(C₃ - C₄) - シクロアルキル、(C₂ - C₃) - アルケニル若しくは (C₂ - C₃) - アルキニル〔ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素及び臭素からなる群から選択される m 個のラジカルで置換されている〕を表し；及び、

20

m は、連続数 0、1、2 又は 3 を表す。

【0067】

一般式 (I) で表される化合物の例が、表形式で以下に示されている。下記表 1 は、式 (I) において概括的に定義されている置換基について具体的に記載している。

30

40

50

【表 1】

表 1：一般式 (I) [式中、 $X^2 = X^4 = X^6 = R^1 = R^2 = H$ 、及び、 $Y = W = O$] で表される化合物

実施例 No.	X ³	X ⁵	R ³	R ⁴	Z	コメント
I-1	F	F	CH ₃	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-2	Cl	Cl	OCH ₃	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-3	Cl	Cl	CH=CH ₂	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-4	Br	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-5	F	F	OCH ₃	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-6	F	F	CF ₃	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-7	F	H	CH=CH ₂	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-8	Br	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-9	F	F	(R)-CH ₃	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-10	F	F	(S)-CH=CH ₂	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1； 2 ジアステレオマー
I-11	F	F	(S)-CH=CH ₂	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1； I-10 のジアステレオマー 1 (単一のエナンチオマー)
I-12	F	F	(S)-CH=CH ₂	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1； I-10 のジアステレオマー 2 (単一のエナンチオマー)
I-13	F	H	CH ₃	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-14	H	H	OCH ₃	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-15	F	F	(R)-CH ₃	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1； ジアステレオマー 1 (単一のエナンチオマー)
I-16	F	F	(R)-CH ₃	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1； ジアステレオマー 2 (単一のエナンチオマー)
I-17	F	F	CH ₃	CH ₃	Z-4	
I-18	F	F	CH ₃	CH ₂ CH ₃	Z-4	
I-19	F	F	CH ₃	CH ₃	Z-2	
I-20	F	H	CH ₃	H	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-21	F	F	CH=CH ₂	H	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-22	F	F	(R)-CH=CH ₂	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-23	F	F	CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Z-3	
I-24	F	F	CH ₃	CH ₂ CH ₃	Z-3	

10

20

30

40

50

実施例 No.	X ³	X ⁵	R ³	R ⁴	Z	コメント
I-25	F	F	CH ₃	CH ₃	Z-3	
I-26	F	F	(S)-CH=CH ₂	CH ₃	Z-2	
I-27	F	F	OCH ₃	CH ₃	Z-2	
I-28	F	F	(R)-CH ₃	CH ₃	Z-2	
I-29	Cl	Cl	OCH ₃	CH ₃	Z-2	
I-30	F	H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-31	F	F	(S)-CH=CH ₂	H	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-32	F	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-33	F	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-34	F	H	CH ₃	CH ₂ Ph	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-35	F	F	(S)-CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-36	F	F	(S)-CH=CH ₂	CH(CH ₃) ₂	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-37	F	F	(S)-CH=CH ₂	CH ₂ Ph	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-38	F	F	(S)-CH=CH ₂	C(CH ₃) ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-39	F	H	CH ₃	CH ₃	Z-13	(4S)-4-アミノ-4,5-ジヒドロフラン-2-カルボキシルト
I-40	F	H	CH ₃	CH ₃	Z-8	(2S,4S)-4-アミノトリアクト-2-カルボキシルト
I-41	F	F	(R)-CH ₃	H	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-42	F	F	(R)-CH ₃	C(CH ₃) ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-43	F	F	(R)-CH ₃	CH ₂ CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-44	F	F	(R)-CH ₃	CH ₂ (CH ₃) ₂	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-45	F	F	(R)-CH ₃	CH ₂ Ph	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-46	F	H	CH ₃	CH ₃	Z-13	(4R)-4-アミノ-4,5-ジヒドロフラン-2-カルボキシルト
I-47	F	H	CH ₃	CH ₃	Z-8	(2R,4R)-4-アミノトリアクト-2-カルボキシルト
I-48	F	F	(R)-CH ₃	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-49	F	F	(R)-CF ₂ CH ₃	CH ₃	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-50	F	F	(R)-CF ₂ CH ₃	H	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-51	F	F	(R)-CF ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-52	F	F	(S)-CH=CH ₂	CH ₂ (3-F-Ph)	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1

10

20

30

40

50

実施例 No.	X ³	X ⁵	R ³	R ⁴	Z	コメント
I-53	F	F	(R) - CH ₃	CH ₂ (3-F-Ph)	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-54	F	F	(S) - CH=CH ₂	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Z-1	2,4-シス型立体配置の Z-1
I-55	F	F	(R) - CH ₃	CH ₃	Z-1	2,4-トランス型立体配置の Z-1
I-56	F	F	(S) - CH=CH ₂	CH ₃	Z-1	2,4-トランス型立体配置の Z-1

10

20

30

40

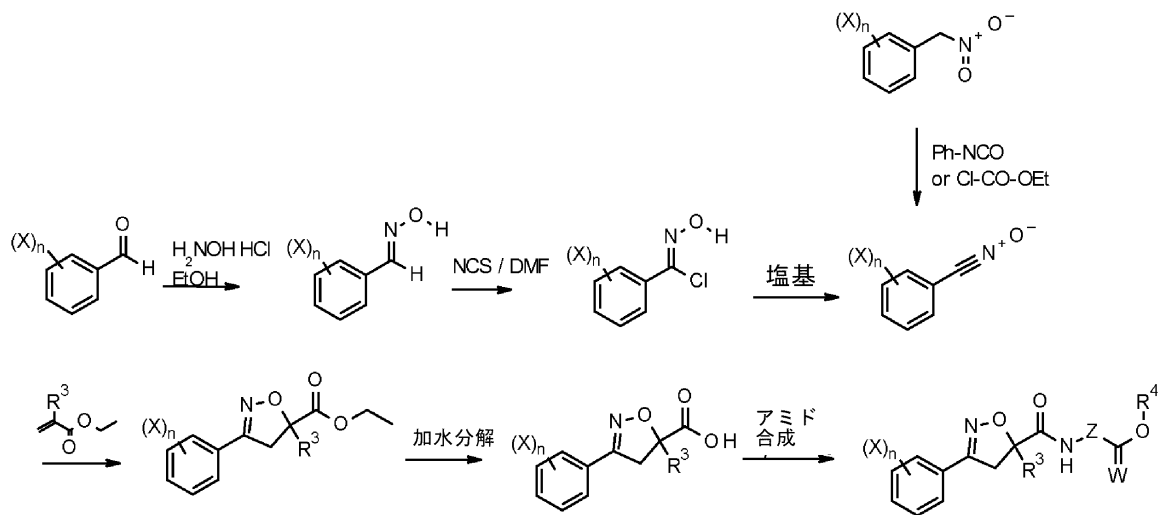
【 0 0 6 8 】

本発明による化合物は、以下に記載されているさまざまなプロセスによって調製することが可能である：

スキーム 1：

50

【化9】



10

【0069】

スキーム1及びそれに続くスキームにおいて、 $(X)_n$ は、置換基 X_2 、 X_3 、 X_4 、 X_5 及び X_6 を表す。ニトリルオキシドと適切な親双極子(dipolarophile)のそのような1,3-双極子付加環化反応は、例えば、「Reviews: 1,3 dipolar Cycloaddition Chemistry, Padwa, ed. Wiley, New York, 1984」、「Kanemasa and Tsuge, Heterocycles 1990, 30, 719」に記載されている。クロロオキシムの調製に関しては、「Kim, Jae N., Ryu, Eung K. J. Org. Chem. 1992, 57, 6649」を参照されたい。

20

【0070】

イソオキサゾリン環系の4位及び5位が置換されている本発明の化合物も、同様に、適切な1,2-二置換されているオレフィンを経双極子として使用することによる1,3-双極子付加環化反応によって、調製することができる。通常、この反応は、カラムクロマトグラフィーによって分離させることが可能なジアステレオマー混合物をもたらす。光学的に活性なイソオキサゾリン類は、適切な前駆物質若しくは最終生成物をキラルHPLCに付すことによって得ることが可能であり、及び、さらに、エナンチオ選択的反応(例えば、酵素的なエステル開裂又はアミド開裂)によって、又は、Olssen(J. Org. Chem. 1988, 53, 2468)によって記載されているように親双極子としてキラル補助剤を使用することによって、得ることも可能である。

30

【0071】

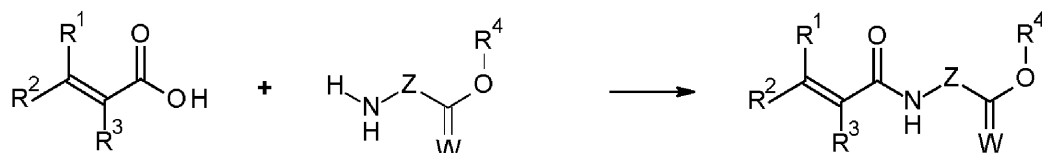
本発明による化合物を調製するために、適切に置換されている2-アルコキシアクリルアミドを使用することも可能である(スキーム3)。これらは、スキーム2に記載されているアクリル酸エステルから、それらを加水分解及びアミド形成に付した後に、得ることができる。

40

【0072】

スキーム2:

【化10】



50

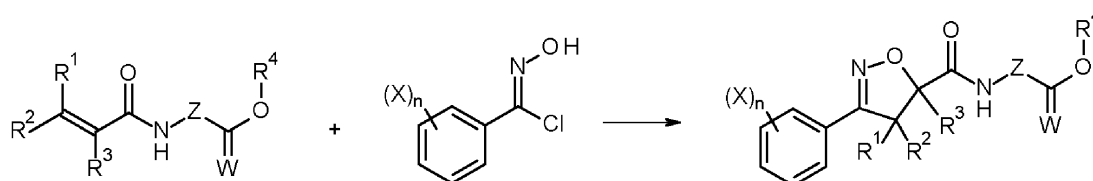
【0073】

該アクリル酸を活性化させるための1つのオプションは、カルボジイミド類、例えば、EDClである(Chen, F. M. F.; Benoiton, N. L. Synthesis 1979, 709)。アクリルアミド類の調製に関しては、US 2,521,902、JP 60112746、「J. of Polymer Science 1979, 17(6), 1655」を参照されたい。適切に置換されているアクリルアミドをニトリルオキシドとの1,3-付加環化反応において反応させて、本発明による化合物を生成させることができる(スキーム3)。

【0074】

スキーム3:

【化11】



【0075】

官能基R³の変換は、アルケン段階で実施することが可能であるか、又は、イソオキサゾリン段階で実施することが可能である。

【0076】

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

【0077】

本発明による式(I)で表される化合物(及び/又はそれらの塩)[以下では、集合的に、「本発明の化合物」と称される]は、広範囲の経済的に重要な単子葉及び双子葉の一年生有害植物に対して優れた除草効力を示す。

【0078】

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

【0079】

以下の属の単子葉有害植物: アエギロプス属(Aegilops)、カモジグサ属(Agrocyron)、ヌカボ属(Agrostis)、スズメノテッポウ属(Alopecurus)、セイヨウヌカボ属(Apera)、カラスムギ属(Avena)、ピロードキビ属(Brachyaria)、スズメノチャヒキ属(Bromus)、クリノイガ

10

20

30

40

50

属 (Cenchrus)、ツククサ属 (Commelina)、ギョウギシバ属 (Cynodon)、カヤツリグサ属 (Cyperus)、タツノツメガヤ属 (Dactyloctenium)、メヒシバ属 (Digitaria)、ヒエ属 (Echinochloa)、ハリイ属 (Eleocharis)、オヒシバ属 (Eleusine)、スズメガヤ属 (Eragrostis)、ナルコビエ属 (Eriochloa)、ウシノケグサ属 (Festuca)、テンツキ属 (Fimbristylis)、アメリカコナギ属 (Heteranthera)、チガヤ属 (Imperata)、カモノハシ属 (Ischaemum)、アゼガヤ属 (Leptochloa)、ドクムギ属 (Lolium)、ミズアオイ属 (Monochoria)、キビ属 (Panicum)、スズメノヒエ属 (Paspalum)、クサヨシ属 (Phalaris)、アワガエリ属 (Phleum)、イチゴツナギ属 (Poa)、ツノアイアシ属 (Rottboellia)、オモダカ属 (Sagittaria)、ホタルイ属 (Scirpus)、エノコログサ属 (Setaria)、モロコシ属 (Sorghum)。

10

【0080】

以下の属の双子葉雑草： イチビ属 (Abutilon)、ヒコ属 (Amaranthus)、ブタクサ属 (Ambrosia)、アノダ属 (Anoda)、カミツレ属 (Anthemis)、アフアネス属 (Aphanes)、ヨモギ属 (Artemisia)、ハマアカザ属 (Atriplex)、ヒナギク属 (Bellis)、センダングサ属 (Bidens)、ナズナ属 (Capsella)、ヒレアザミ属 (Carduus)、カワラケツメイ属 (Cassia)、ヤグルマギク属 (Centaurea)、アカザ属 (Chenopodium)、アザミ属 (Cirsium)、セイヨウヒルガオ属 (Convolvulus)、チョウセンアサガオ属 (Datura)、ヌスビトハギ属 (Desmodium)、エメキス属 (Emex)、エゾスズシロ属 (Erysimum)、トウダイグサ属 (Euphorbia)、チシマオドリコソウ属 (Galeopsis)、コゴメギク属 (Galinsoga)、ヤエムグラ属 (Galium)、フヨウ属 (Hibiscus)、サツマイモ属 (Ipomoea)、ホウキギ属 (Kochia)、オドリコソウ属 (Lamium)、マメグンバイナズナ属 (Lepidium)、アゼトウガラシ属 (Lindernia)、シカギク属 (Matricaria)、ハッカ属 (Mentha)、ヤマアイ属 (Mercurialis)、ザクロソウ属 (Mullugo)、ウスレナグサ属 (Myosotis)、ケシ属 (Papaver)、アサガオ属 (Pharbitis)、オオバコ属 (Plantago)、タデ属 (Polygonum)、スベリヒコ属 (Portulaca)、キンボウゲ属 (Ranunculus)、ダイコン属 (Raphanus)、イヌガラシ属 (Rorippa)、キカシグサ属 (Rotala)、ギシギシ属 (Rumex)、オカヒジキ属 (Salsola)、キオン属 (Senecio)、セスバニア属 (Sesbania)、キンゴジカ属 (Sida)、シロガラシ属 (Sinapis)、ナス属 (Solanum)、ノゲシ属 (Sonchus)、ナガボノウルシ属 (Sphenoclea)、ハコベ属 (Stellaria)、タンポポ属 (Taraxacum)、グンバイナズナ属 (Thlaspi)、シャジクソウ属 (Trifolium)、イラクサ属 (Urtica)、クワガタソウ属 (Veronica)、スミレ属 (Viola)、オナモミ属 (Xanthium)。

20

30

40

【0081】

本発明の化合物が発芽前に土壌表面に施用される場合、雑草の実生の出芽が完全に防止されるか、又は、雑草は、子葉期に達するまで成長するが、その後成長を停止する。

【0082】

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

【0083】

本発明の化合物は、有用な植物の作物の中で選択的であることができ、そして、非選択的

50

除草剤として使用することも可能である。

【0084】

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

10

【0085】

好ましくは、有用な植物及び観賞植物の経済的に重要なトランスジェニック作物において、本発明の式（I）で表される化合物又はその塩を使用する。

【0086】

式（I）で表される化合物は、除草剤として、当該除草剤の植物毒性効果に対して抵抗性であるか又は遺伝子工学によって抵抗性にされた有用な植物の作物において、使用することができる。

20

【0087】

既存の植物と比較して改質された特性を有する新規植物を生成させる慣習的な方法は、例えば、従来の栽培法及び突然変異体の生成である。別法として、変更された特性を有する新規植物は、組換え法を用いて生成させることができる（例えば、EP 0221044、EP 0131624を参照されたい）。例えば、記載されているのは、以下のことに關するいくつかの場合である：植物体内で合成されるデンプンを改質することを目的とする作物植物の遺伝子組換え（例えば、WO 92/011376A、WO 92/014827A、WO 91/019806A）； グルホシネートタイプ（cf. 例えば、EP 0242236A、EP 0242246A）若しくはグリホセートタイプ（WO 92/000377A）若しくはスルホニル尿素タイプ（EP 0257993A、US 5,013,659）の特定の除草剤に対して抵抗性を示す、又は、「遺伝子スタッキング（gene stacking）」によってそれら除草剤の組合せ若しくは混合物に対して抵抗性を示す、トランスジェニック作物植物、例えば、Optimum™ GATM（グリホセートALS耐性）の商品名又は名称を有するトランスジェニック作物植物、例えば、トウモロコシ又はダイズ；

30

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

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

40

- ・ 新規成分又は二次代謝産物（例えば、耐病性を向上させる新規フィトアレキシンなど）を有する遺伝子組換えされた作物植物（EP 0309862A、EP 0464461A）；

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

- ・ 薬学的に又は診断的に重要なタンパク質を産生するトランスジェニック作物植物（「分子ファーミング（molecular pharming）」）；

- ・ より多い収穫量又はより優れた品質を特徴とするトランスジェニック作物植物；

- ・ 例えば上記で記載した新規特性の組み合わせによって区別される、トランスジェニック作物植物（「遺伝子スタッキング」）。

50

【0088】

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

【0089】

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

【0090】

例えば、遺伝子産物の活性が低下した植物細胞の生成は、少なくとも1の対応するアンチセンスRNAを発現させることによって、又は、コサプレッション効果を達成するためのセンスRNAを発現させることによって、又は、前記遺伝子産物の転写産物を特異的に切断する少なくとも1の適切に構築されたりボザイムを発現させることによって、達成することができる。この目的のために、最初に、存在し得る全てのランキング配列を含む遺伝子産物の全コード配列を含んでいるDNA分子を使用することが可能であり、さらにまた、コード配列の一部だけを含んでいるDNA分子（この場合、これらの部分は、細胞内においてアンチセンス効果を有するのに十分なほど長いことが必要である）を使用することも可能である。さらにまた、遺伝子産物のコード配列と高度に相同性を有するが、それらと完全に同一であるわけではないDNA配列を用いることもできる。

【0091】

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

【0092】

トランスジェニック植物細胞は、完全な植物を生じさせるための既知技術によって再生させることができる。原則として、トランスジェニック植物は、任意の望ましい植物種の植物であり得る、即ち、単子葉植物であり得るのみではなく、双子葉植物でもあり得る。

【0093】

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

【0094】

10

20

30

40

50

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

【0095】

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

【0096】

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

【0097】

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

【0098】

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

【0099】

本発明の化合物は、必要とされる生物学的及び/又は物理化学的パラメータに応じて、さまざまな方法で製剤することができる。可能な製剤としては、例えば、以下のものを挙げることができる：水和剤（WP）、水溶性（water-soluble powder）（SP）、水溶性濃厚剤（water-soluble concentrates）、乳剤（EC）、エマルジョン剤（EW）、例えば、水中油型エマルジョン剤及び油中水型エマルジョン剤、散布可能溶液剤（sprayable solutions）、懸濁製剤（SC）、油又は水に基づく分散液剤、油混和性溶液剤、カプセル懸濁製剤（capsule suspensions）（CS）、散粉性製品（dusting products）（DP）、粉衣剤（dressings）、ばらまき用顆粒剤及び土壌施用用顆粒剤、微粒剤の形態にある顆粒剤（GR）、噴霧剤（spray granules）、吸収剤（absorption granules）及び含浸剤（adsorption granules）、顆粒水和剤（WG）、水溶性剤（SG）、微量散布製剤、マイクロカプセル剤、並びに、蠟剤（waxes）。これらの個々の製剤の型は原則として知られており、そして、例えば、以下のものに記載されている：「Winnacker-Kuchler, "Chemische Technologie" [Chemical Technology], Volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th Ed. 1986」、*Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker*

10

20

30

40

50

、 N . Y . , 1 9 7 3 」、 「 K . M a r t e n s , “ S p r a y D r y i n g ” H a n d b o o k , 3 r d E d . 1 9 7 9 , G . G o o d w i n L t d . L o n d o n 」。

【 0 1 0 0 】

不活性物質、界面活性剤、溶媒及びさらなる添加剤などの必要とされる製剤助剤も同様に知られており、そして、例えば、以下のものに記載されている：「 W a t k i n s , “ H a n d b o o k o f I n s e c t i c i d e D u s t D i l u e n t s a n d C a r r i e r s ” , 2 n d E d . , D a r l a n d B o o k s , C a l d w e l l N . J . 」、「 H . v . O l p h e n , “ I n t r o d u c t i o n t o C l a y C o l l o i d C h e m i s t r y ” , 2 n d E d . , J . W i l e y & S o n s , N . Y . 」、「 C . M a r s d e n , “ S o l v e n t s G u i d e ” , 2 n d E d . , I n t e r s c i e n c e , N . Y . 1 9 6 3 」、 「 M c C u t c h e o n ’ s “ D e t e r g e n t s a n d E m u l s i f i e r s A n n u a l ” , M C P u b l . C o r p . , R i d g e w o o d N . J . 」、「 S i s l e y a n d W o o d , “ E n c y c l o p e d i a o f S u r f a c e A c t i v e A g e n t s ” , C h e m . P u b l . C o . I n c . , N . Y . 1 9 6 4 」、 「 S c h o n f e l d t , “ G r e n z f l a c h e n a k t i v e A t h y l e n o x i d a d d u k t e ” [I n t e r f a c e - a c t i v e E t h y l e n e O x i d e A d d u c t s] , W i s s . V e r l a g s g e s e l l . , S t u t t g a r t 1 9 7 6 」、 「 W i n n a c k e r - K u c h l e r , “ C h e m i s c h e T e c h n o l o g i e ” , v o l u m e 7 , C . H a n s e r V e r l a g M u n i c h , 4 t h E d . 1 9 8 6 」。 10

【 0 1 0 1 】

これらの製剤に基づいて、別の活性化合物（例えば、殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、殺菌剤）との組合せ物や、さらにまた、葉害軽減剤、肥料及び/若しくは成長調節剤との組合せ物を、例えば、完成した製剤の形態で又はタンクミックスとして、製造することも可能である。

【 0 1 0 2 】

混合製剤中で又はタンクミックスの中で本発明による化合物と組合せて使用することが可能な活性化合物は、例えば、「 W e e d R e s e a r c h 2 6 (1 9 8 6) 4 4 1 - 4 4 5 」又は「 “ T h e P e s t i c i d e M a n u a l ” , 1 6 t h e d i t i o n , T h e B r i t i s h C r o p P r o t e c t i o n C o u n c i l a n d t h e R o y a l S o c . o f C h e m i s t r y , 2 0 0 6 」及びそれらの中で引用されている文献に記載されている、例えば、アセト乳酸シンターゼ、アセチル - C o A カルボキシラーゼ、セルロースシンターゼ、エノールピルビルシキミ酸 - 3 - リン酸シンターゼ、グルタミンシンターゼ、p - ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ、フィトエンデサチュラーゼ、光化学系 I、光化学系 II 又はプロトポルフィリノーゲンオキシダーゼなどを阻害することに基づく、例えば、既知活性化合物である。本発明による化合物と組み合わせることが可能な既知除草剤又は既知植物成長調節剤は、例えば、以下の活性化合物であり、ここで、該化合物は、国際標準化機構 (I S O) に従う「一般名」で示されているか、又は、化学名で示されているか、又は、コード番号で示されている。それらは、たとえ明示的に言及されていなくても、常に、全ての施用形態、例えば、酸、塩、エステル、及び、全ての異性体、例えば、立体異性体及び光学異性体などを包含する。 30

【 0 1 0 3 】

そのような除草性混合相手剤の例は、以下のとおりである：

アセトクロル、アシフルオルフェン、アシフルオルフェン - ナトリウム、アラクロール、アリドクロール、アロキシジム、アロキシジム - ナトリウム、アメトリン、アミカルパゾン、アミドクロル、アミドスルフロン、4 - アミノ - 3 - クロロ - 6 - (4 - クロロ - 2 - フルオロ - 3 - メチルフェニル) - 5 - フルオロピリジン - 2 - カルボン酸、アミノシ 40

クロピラクロール、アミノシクロピラクロール - カリウム、アミノシクロピラクロール - メチル、アミノピラリド、アミトロール、スルファミン酸アンモニウム、アニロホス、アスラム、アトラジン、アザフェニジン、アジムスルフロソ、ベフルブタミド、ベナゾリン、ベナゾリン - エチル、ベンフルラリン、ベンフレセート、ベンスルフロソ、ベンスルフロソ - メチル、ベンスリド、ベントゾン、ベンゾピシクロソ、ベンゾフェナップ、ピシクロピロソ、ピフェノックス、ピラナホス、ピラナホス - ナトリウム、ビスピリバック、ビスピリバック - ナトリウム、プロマシル、プロモブチド、プロモフェノキシム、プロモキシニル、プロモキシニル - ブチレート、 - カリウム、 - ヘプタノエート及び - オクタノエート、ブソキシノン (busoxinone)、ブタクロール、ブタフェナシル、ブタミホス、ブテナクロール、ブトラリン、ブトロキシジム、ブチレート、カフェンストロール、カルベタミド、カルフェントラゾン、カルフェントラゾン - エチル、クロランベン、クロルブロムロン、クロルフェナク、クロルフェナク - ナトリウム、クロルフェンプロップ、クロルフルレノール、クロルフルレノール - メチル、クロリダゾン、クロリムロン、クロリムロン - エチル、クロロフタリム、クロロトルロン、クロルタール - ジメチル、クロルスルフロソ、シニドン、シニドン - エチル、シンメチリン、シノスルフロソ、クラシホス、クレトジム、クロジナホップ、クロジナホップ - プロパルギル、クロマゾン、クロメプロップ、クロピラリド、クロランスラム、クロランスラム - メチル、クミルロン、シアナミド、シアナジン、シクロエート、シクロピリモレート、シクロスルファミロン、シクロキシジム、シハロホップ、シハロホップ - ブチル、シブラジン、2, 4 - D、2, 4 - D - ブトチル、 - ブチル、 - ジメチルアンモニウム、 - ジオールアミン、 - エチル、2 - エチルヘキシル、 - イソブチル、 - イソオクチル、 - イソプロピルアンモニウム、 - カリウム、 - トリイソプロパノールアンモニウム及び - トロールアミン (trolamine)、2, 4 - DB、2, 4 - DB - ブチル、 - ジメチルアンモニウム、 - イソオクチル、 - カリウム及び - ナトリウム、ダイムロン (daimuron) (dymron)、ダラボン、ダゾメット、n - デカノール、デスメジファミ、デトシル - ピラゾレート (DTP)、ジカンバ、ジクロベニル、2 - (2, 4 - ジクロロベンジル) - 4, 4 - ジメチル - 1, 2 - オキサゾリジン - 3 - オン、2 - (2, 5 - ジクロロベンジル) - 4, 4 - ジメチル - 1, 2 - オキサゾリジン - 3 - オン、ジクロルプロップ、ジクロルプロップ - P、ジクロホップ、ジクロホップ - メチル、ジクロホップ - P - メチル、ジクロスラム、ジフェンゾコート、ジフルフェニカン、ジフルフェンゾピル、ジフルフェンゾピル - ナトリウム、ジメフロソ、ジメピペレート、ジメタクロール、ジメタメトリン、ジメテナミド、ジメテナミド - P、ジメトラスルフロソ、ジニトラミン、ジノテルブ、ジフェナミド、ジクワット、ジクワットジプロミド、ジチオピル、ジウロン、DNOC、エンドタール、EPTC、エスプロカルブ、エタルフルラリン、エタメトスルフロソ、エタメトスルフロソ - メチル、エチオジン、エトフメセート、エトキシフェン、エトキシフェン - エチル、エトキシスルフロソ、エトベンザニド、F - 9600、F - 5231、即ち、N - [2 - クロロ - 4 - フルオロ - 5 - [4 - (3 - フルオロプロピル) - 4, 5 - ジヒドロ - 5 - オキソ - 1 H - テトラゾール - 1 イル] フェニル] エタンスルホンアミド、F - 7967、即ち、3 - [7 - クロロ - 5 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 4 - イル] - 1 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) ピリミジン - 2, 4 (1 H, 3 H) - ジオン、フェノキサプロップ、フェノキサプロップ - P、フェノキサプロップ - エチル、フェノキサプロップ - P - エチル、フェノキサスルホン、フェンキノトリオン、フェントラザミド、フラムプロップ、フラムプロップ - M - イソプロピル、フラムプロップ - M - メチル、フラザスルフロソ、フロラスラム、フルアジホップ、フルアジホップ - P、フルアジホップ - ブチル、フルアジホップ - P - ブチル、フルカルバゾン、フルカルバゾン - ナトリウム、フルセトスルフロソ、フルクロラリン、フルフェナセット、フルフェンピル、フルフェンピル - エチル、フルメツラム、フルミクロラック、フルミクロラック - ペンチル、フルミオキサジン、フルオメツロン、フルレノール、フルレノール - ブチル、 - ジメチルアンモニウム及び - メチル、フルオログリコフェン、フルオログリコフェン - エチル、フルプロパネート、フルピルスルフロソ、フルピルスルフロソ - メチル - ナ

10

20

30

40

50

トリウム、フルリドン、フルロクロリドン、フルロキシピル、フルロキシピル - メプチル、フルルタモン、フルチアセット、フルチアセット - メチル、ホメサフェン、ホメサフェン - ナトリウム、ホラムスルフロソ、ホサミン、グルホシネート、グルホシネート - アンモニウム、グルホシネート - P - ナトリウム、グルホシネート - P - アンモニウム、グルホシネート - P - ナトリウム、グリホセート、グリホセート - アンモニウム、 - イソプロピルアンモニウム、 - ジアンモニウム、 - ジメチルアンモニウム、 - カリウム、 - ナトリウム及び - トリメシウム、H - 9 2 0 1、即ち、O - (2 , 4 - ジメチル - 6 - ニトロフェニル) O - エチル イソプロピルホスホルアミドチオエート、ハラウキシフェン、ハラウキシフェン - メチル、ハロサフェン、ハロスルフロソ、ハロスルフロソ - メチル、ハロキシホップ、ハロキシホップ - P、ハロキシホップ - エトキシエチル、ハロキシホップ - P - エトキシエチル、ハロキシホップ - メチル、ハロキシホップ - P - メチル、ヘキサジノン、HW - 0 2、即ち、1 - (ジメトキシホスホリル) エチル (2 , 4 - ジクロロフェノキシ) アセテート、イマザメタベンズ、イマザメタベンズ - メチル、イマザモックス、イマザモックス - アンモニウム、イマザピック、イマザピック - アンモニウム、イマザピル、イマザピル - イソプロピルアンモニウム、イマザキン、イマザキン - アンモニウム、イマゼタピル、イマゼタピル - イモニウム (i m m o n i u m)、イマゾスルフロソ、インダノファン、インダジフラム、ヨードスルフロソ、ヨードスルフロソ - メチル - ナトリウム、アイオキシニル、アイオキシニル - オクタノエート、 - カリウム及び - ナトリウム、イプフェンカルバゾン、イソプロツロン、イソウロン、イソキサベン、イソキサフルトール、カルブチレート、K U H - 0 4 3、即ち、3 - ({ [5 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] メチル } スルホニル) - 5 , 5 - ジメチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール、ケトスピラドックス (k e t o s p i r a d o x)、ラクトフェン、レナシル、リニユロン、M C P A、M C P A - ブトチル、 - ジメチルアンモニウム、 - 2 - エチルヘキシル、 - イソプロピルアンモニウム、 - カリウム及び - ナトリウム、M C P B、M C P B - メチル、 - エチル及び - ナトリウム、メコプロップ、メコプロップ - ナトリウム及び - ブトチル、メコプロップ - P、メコプロップ - P - ブトチル、 - ジメチルアンモニウム、 - 2 - エチルヘキシル及び - カリウム、メフェナセット、メフルイジド、メソスルフロソ、メソスルフロソ - メチル、メソトリオン、メタベンズチアズロン、メタム、メタミホップ、メタミトロン、メタザクロール、メタゾスルフロソ、メタベンズチアズロン、メチオピルスルフロソ (m e t h i o p y r s u l f u r o n)、メチオゾリン、イソチオシアン酸メチル、メトブロムロン、メトラクロール、S - メトラクロール、メトスラム、メトクスロン、メトリブジン、メトスルフロソ、メトスルフロソ - メチル、モリネート、モノリニユロン、モノスルフロソ、モノスルフロソ - エステル、M T - 5 9 5 0、即ち、N - [3 - クロロ - 4 - (1 - メチルエチル) フェニル] - 2 - メチルペンタンアミド、N G G C - 0 1 1、ナプロパミド、N C - 3 1 0、即ち、4 - (2 , 4 - ジクロロベンゾイル) - 1 - メチル - 5 - ベンジルオキシピラゾール、ネブロン、ニコスルフロソ、ノナン酸 (ペラルゴン酸)、ノルフルラゾン、オレイン酸 (脂肪酸)、オルベンカルブ、オルソスルファミロン、オリザリン、オキサジアルギル、オキサジアゾン、オキサスルフロソ、オキサジクロメフォン、オキシフルオルフェン、パラコート、パラコートジクロリド、ペブレート、ペンジメタリン、ペノキススラム、ペンタクロロフェノール、ペントキサゾン、ペトキサミド、石油、フェンメジファミン、ピクロラム、ピコリナフェン、ピノキサデン、ピペロホス、プレチラクロール、プリミスルフロソ、プリミスルフロソ - メチル、プロジアミン、プロホキシジム、プロメトン、プロメトリン、プロパクロール、プロパニル、プロパキサホップ、プロパジン、プロファミン、プロピソクロール、プロポキシカルバゾン、プロポキシカルバゾン - ナトリウム、プロピリスルフロソ、プロピザミド、プロスルホカルブ、プロスルフロソ、ピラクロニル、ピラフルフェン、ピラフルフェン - エチル、ピラスルホトール、ピラゾリネート (ピラゾレート)、ピラゾスルフロソ、ピラゾスルフロソ - エチル、ピラゾキシフェン、ピリバムベンズ (p y r i b a m b e n z)、ピリバムベンズ - イソプロピル、ピリバムベンズ - プロピル、ピリベンゾキシム、ピリブチカルブ、ピリダフォル、ピリ

10

20

30

40

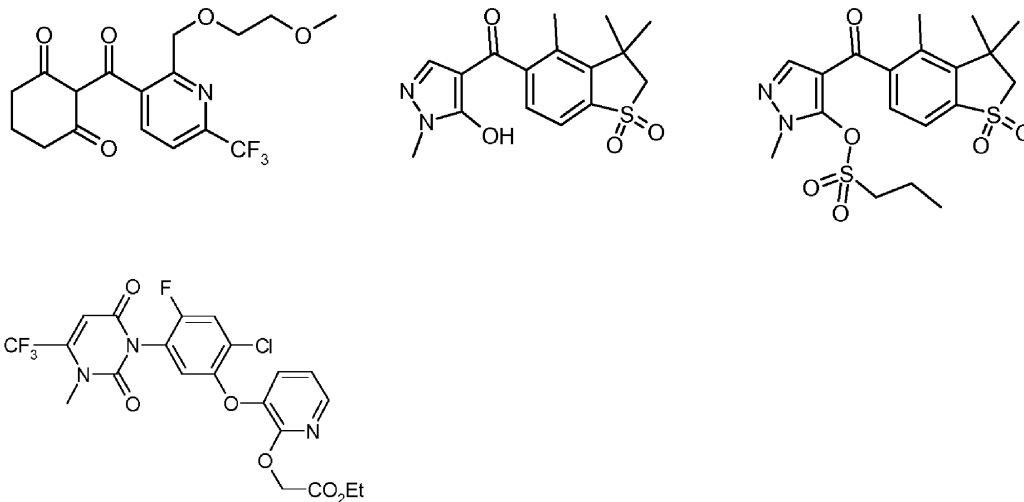
50

デート、ピリフタリド、ピリミノバック、ピリミノバック - メチル、ピリミスルファン、ピリチオバック、ピリチオバック - ナトリウム、ピロキサスルホン、ピロキシスラム、キンクロラック、キンメラック、キノクラミン、キザロホップ、キザロホップ - エチル、キザロホップ - P、キザロホップ - P - エチル、キザロホップ - P - テフリル、リムスルフロロン、サフルフェナシル、セトキシジム、シデュロン、シマジン、シメトリン、SL - 261、スルコトリオン、スルフェントラゾン、スルホメツロン、スルホメツロン - メチル、スルホスルフロロン、SYN - 523、SYP - 249、即ち、1 - エトキシ - 3 - メチル - 1 - オキソブタ - 3 - エン - 2 - イル 5 - [2 - クロロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェノキシ] - 2 - ニトロベンゾエート、SYP - 300、即ち、1 - [7 - フルオロ - 3 - オキソ - 4 - (プロバ - 2 - イン - 1 - イル) - 3, 4 - ジヒドロ - 2H - 1, 4 - ベンゾオキサジン - 6 - イル] - 3 - プロピル - 2 - チオキソイミダゾリジン - 4, 5 - ジオン、2, 3, 6 - TBA、TCA (トリフルオロ酢酸)、TCA - ナトリウム、テブチウロン、テフリルトリオン、テンボトリオン、テプラロキシジム、ターバシル、テルブカルブ、テルブメトン、テルブチラジン、テルブトリン、テニルクロール、チアゾピル、チエンカルバゾン、チエンカルバゾン - メチル、チフェンスルフロロン、チフェンスルフロロン - メチル、チオベンカルブ、チアフェナシル、トルピラレート、トプラメゾン、トラルコキシジム、トリアファモン、トリアレート、トリアスルフロロン、トリアジフラム、トリベヌロン、トリベヌロン - メチル、トリクロピル、トリエタジン、トリフロキシスルフロロン、トリフロキシスルフロロン - ナトリウム、トリフルジモキサジン (trifludimoxazin)、トリフルラリン、トリフルスルフロロン、トリフルスルフロロン - メチル、トリトスルフロロン、尿素硫酸塩 (urea sulfate)、ベルノレート、XDE - 848、ZJ - 0862、即ち、3, 4 - ジクロロ - N - { 2 - [(4, 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) オキシ] ベンジル } アニリン、及び、さらに、以下の化合物：

【化12】

10

20



30

【0104】

可能な混合相手剤としての植物成長調節剤の例は、以下のものである：

アシベンゾラル、アシベンゾラル - S - メチル、5 - アミノレブリン酸、アンシミドール、6 - ベンジルアミノプリン、ブラシノリド、カテコール、クロルメコート - クロリド、クロプロップ、シクラニリド、3 - (シクロプロパ - 1 - エニル) プロピオン酸、ダミノジド、ダゾメット、n - デカノール、ジケグラック、ジケグラック - ナトリウム、エンドタール、エンドタール - ニカリウム、 - ニナトリウム及びモノ (N, N - ジメチルアルキルアンモニウム)、エテホン、フルメトラリン、フルレノール、フルレノール - プチル、フルルプリミドール、ホルクロルフェニユロン、ジベレリン酸、イナベンフィド、インドール - 3 - 酢酸 (IAA)、4 - インドール - 3 - イル酪酸、イソプロチオラン、プロベナゾール、ジャスモン酸、ジャスモン酸メチルエステル、マレイン酸ヒドラジド、メピコ

40

50

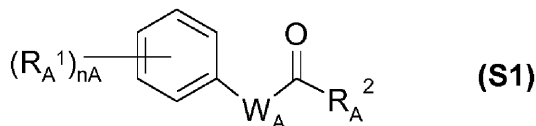
ートクロリド、1 - メチルシクロプロペン、2 - (1 - ナフチル) アセトアミド、1 - ナフチル酢酸、2 - ナフチルオキシ酢酸、ニトロフェノキシド混合物、4 - オキソ - 4 - [(2 - フェニルエチル) アミノ] 酪酸、パクロブトラゾール、N - フェニルフタルアミド酸、プロヘキサジオン、プロヘキサジオン - カルシウム、プロヒドロジャスモン、サリチル酸、ストリゴラクトン、テクナゼン、チジアズロン、トリアコンタノール、トリネキサパック、トリネキサパック - エチル、チトデフ (t s i t o d e f)、ウニコナゾール、ウニコナゾール - P。

【0105】

本発明による式 (I) で表される化合物と組み合わせて使用することが可能な、及び、場合により、さらなる活性化合物 (例えば、上記で挙げられている殺菌剤、除草剤、殺ダニ剤、殺虫剤) と組み合わせて使用することが可能な、薬害軽減剤は、好ましくは、以下のものからなる群から選択される：

(S1) 式 (S1)

【化13】



【0106】

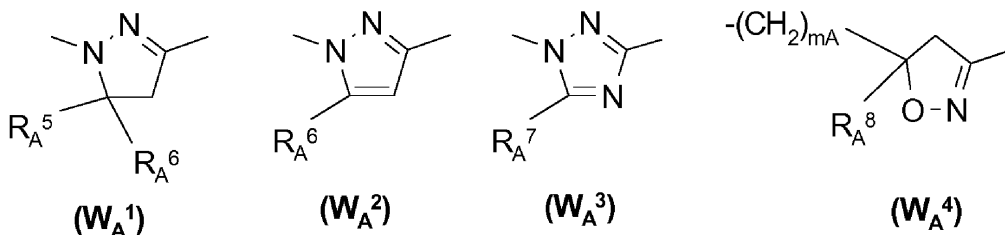
〔式中、記号及び添え字は、以下のように定義される：

n_A は、0 ~ 5 の自然数、好ましくは、0 ~ 3 の自然数を表し；

R_A^1 は、ハロゲン、(C1 - C4) - アルキル、(C1 - C4) - アルコキシ、ニトロ又は (C1 - C4) - ハロアルキルを表し；

W_A は、N 及び O の群から選択される 1 ~ 3 個の環ヘテロ原子を有する部分的不飽和又は芳香族の 5 員ヘテロ環の群から選択される置換されていないか又は置換されている二価ヘテロ環式ラジカル (ここで、該環中には、少なくとも 1 個の窒素原子及び最大で 1 個の酸素原子が存在している) を表し、好ましくは、(W_A^1) ~ (W_A^4)

【化14】



【0107】

の群から選択されるラジカルを表し；

m_A は、0 又は 1 を表し；

R_A^2 は、 OR_A^3 、 SR_A^3 若しくは $NR_A^3R_A^4$ を表すか、又は、少なくとも 1 個の窒素原子と最大で 3 個までのヘテロ原子 (好ましくは、O 及び S からなる群から選択されるヘテロ原子) を有する飽和若しくは不飽和の 3 ~ 7 員のヘテロ環 (ここで、該ヘテロ環は、窒素原子を介して (S1) 内のカルボニル基に結合しており、そして、該ヘテロ環は、置換されていないか、又は、(C1 - C4) - アルキル、(C1 - C4) - アルコキシ若しくは置換されていてもよいフェニルからなる群から選択されるラジカルで置換されている) を表し、好ましくは、式 OR_A^3 、式 NHR_A^4 又は式 $N(CH_3)_2$ で表されるラジカルを表し、特に、式 OR_A^3 で表されるラジカルを表し；

R_A^3 は、水素を表すか、又は、置換されていないか若しくは置換されている (好ましく

10

20

30

40

50

は、合計で1～18個の炭素原子を有する)脂肪族炭化水素ラジカルを表し;

R_{A4} は、水素、(C₁-C₆)-アルキル、(C₁-C₆)-アルコキシを表すか、又は、置換されているか若しくは置換されていないフェニルを表し;

R_{A5} は、H、(C₁-C₈)-アルキル、(C₁-C₈)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ-(C₁-C₈)-アルキル、シアノ又はCOOR_{A9}(ここで、 R_{A9} は、水素、(C₁-C₈)-アルキル、(C₁-C₈)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ-(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₆)-ヒドロキシアルキル、(C₃-C₁₂)-シクロアルキル又はトリ-(C₁-C₄)-アルキルシリルを表す)を表し;

R_{A6} 、 R_{A7} 、 R_{A8} は、同一であるか又は異なっており、そして、水素、(C₁-C₈)-アルキル、(C₁-C₈)-ハロアルキル、(C₃-C₁₂)-シクロアルキルを表すか、又は、置換されているか若しくは置換されていないフェニルを表す)

で表される化合物;

好ましくは:

(a) ジクロロフェニルピラゾリン-3-カルボン酸のタイプの化合物(S1a)、好ましくは、以下のような化合物: 1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(エトキシカルボニル)-5-メチル-2-ピラゾリン-3-カルボン酸、1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(エトキシカルボニル)-5-メチル-2-ピラゾリン-3-カルボン酸エチル(S1-1)('メフェンピル-ジエチル')及び関連化合物(これらは、WO-A-91/07874に記載されている);

(b) ジクロロフェニルピラゾールカルボン酸の誘導体(S1b)、好ましくは、以下のような化合物: 1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-メチルピラゾール-3-カルボン酸エチル(S1-2)、1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-イソプロピルピラゾール-3-カルボン酸エチル(S1-3)、1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(1,1-ジメチルエチル)ピラゾール-3-カルボン酸エチル(S1-4)及び関連化合物(これらは、EP-A-333131及びEP-A-269806に記載されている);

(c) 1,5-ジフェニルピラゾール-3-カルボン酸の誘導体(S1c)、好ましくは、以下のような化合物: 1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-フェニルピラゾール-3-カルボン酸エチル(S1-5)、1-(2-クロロフェニル)-5-フェニルピラゾール-3-カルボン酸メチル(S1-6)及び関連化合物(これらは、例えば、EP-A-268554に記載されている);

(d) トリアゾールカルボン酸のタイプの化合物(S1d)、好ましくは、以下のような化合物: フェンクロラゾール(-エチルエステル)、即ち、1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-トリクロロメチル-(1H)-1,2,4-トリアゾール-3-カルボン酸エチル(S1-7)及び関連化合物(これらは、EP-A-174562及びEP-A-346620に記載されている);

(e) 5-ベンジル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸若しくは5-フェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸のタイプ又は5,5-ジフェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸のタイプの化合物(S1e)、好ましくは、以下のような化合物: 5-(2,4-ジクロロベンジル)-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸エチル(S1-8)若しくは5-フェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸エチル(S1-9)及び関連化合物(これらは、WO-A-91/08202に記載されている)、又は、5,5-ジフェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸(S1-10)若しくは5,5-ジフェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸エチル(S1-11)('イソキサジフェン-エチル')若しくは5,5-ジフェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸n-プロピル(S1-12)若しくは5-(4-フルオロフェニル)-5-フェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸エチル(S1-13)(これらは、特許出願WO-A-95/07897に記載されている)。

【0108】

10

20

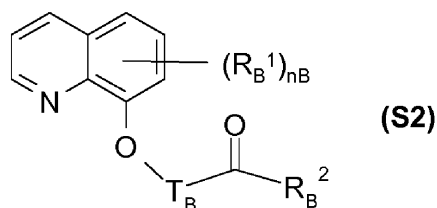
30

40

50

(S2) 式(S2)

【化15】



【0109】

〔式中、記号及び添え字は、下記意味を有する：

R_B^1 は、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ、ニトロ又は $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキルを表し；

n_B は、0～5の自然数、好ましくは、0～3の自然数を表し；

R_B^2 は、 OR_B^3 、 SR_B^3 若しくは $NR_B^3R_B^4$ を表すか、又は、少なくとも1個の窒素原子と最大で3個までのヘテロ原子（好ましくは、O及びSの群から選択されるヘテロ原子）を有する飽和又は不飽和の3～7員のヘテロ環（ここで、該ヘテロ環は、窒素原子を介して(S2)内のカルボニル基に結合しており、そして、該ヘテロ環は、置換されていないか、又は、 $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ若しくは置換されていてもよいフェニルの群から選択されるラジカルで置換されている）を表し、好ましくは、式 OR_B^3 、式 NHR_B^4 又は式 $N(CH_3)_2$ で表されるラジカルを表し、特に、式 OR_B^3 で表されるラジカルを表し；

R_B^3 は、水素を表すか、又は、置換されていないか若しくは置換されている（好ましくは、合計で1～18個の炭素原子を有する）脂肪族炭化水素ラジカルを表し；

R_B^4 は、水素、 $(C_1 - C_6)$ -アルキル、 $(C_1 - C_6)$ -アルコキシを表すか、又は、置換されているか若しくは置換されていないフェニルを表し；

T_B は、 (C_1) 、又は、 (C_2) -アルカンジイル鎖（ここで、該アルカンジイル鎖は、置換されていないか、又は、1若しくは2の $(C_1 - C_4)$ -アルキルラジカルで置換されているか、又は、 $[(C_1 - C_3)$ -アルコキシ]カルボニルで置換されている）を表す）で表されるキノリン誘導体；

好ましくは：

(a) 8-キノリンオキシ酢酸のタイプの化合物(S2a)、好ましくは、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸1-メチルヘキシル(「クロキントセット-メキシル」)(S2-1)、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸(1,3-ジメチル-ブタ-1-イル)(S2-2)、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸4-アリルオキシブチル(S2-3)、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸1-アリルオキシプロパ-2-イル(S2-4)、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸エチル(S2-5)、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸メチル(S2-6)、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸アリル(S2-7)、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸2-(2-プロピリデンイミノオキシ)-1-エチル(S2-8)、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸2-オキソプロパ-1-イル(S2-9)及び関連化合物（これらは、EP-A-86750、EP-A-94349及びEP-A-191736又はEP-A-0492366に記載されている）、並びに、さらに、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)酢酸(S2-10)、その水和物及び塩、例えば、そのリチウム塩、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩、アルミニウム塩、鉄塩、アンモニウム塩、第4級アンモニウム塩、スルホニウム塩又はホスホニウム塩（これらは、WO-A-2002/34048に記載されている）；

(b) (5-クロロ-8-キノリンオキシ)マロン酸のタイプの化合物(S2b)、好ましくは、以下のような化合物：(5-クロロ-8-キノリンオキシ)マロン酸ジエチル、(5-クロロ-8-キノリンオキシ)マロン酸ジアリル、(5-クロロ-8-キノリン

10

20

30

40

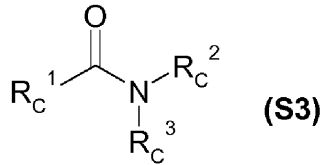
50

オキシ)マロン酸メチルエチル及び関連化合物(これらは、EP-A-0582198に記載されている)。

【0110】

(S3) 式(S3)

【化16】



10

【0111】

[式中、記号及び添え字は、以下のように定義される:]

R_C¹は、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₂-C₄)-アルケニル、(C₂-C₄)-ハロアルケニル、(C₃-C₇)-シクロアルキルを表し、好ましくは、ジクロロメチルを表し;

R_C²、R_C³は、同一であるか若しくは異なっており、そして、水素、(C₁-C₄)-アルキル、(C₂-C₄)-アルケニル、(C₂-C₄)-アルキニル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₂-C₄)-ハロアルケニル、(C₁-C₄)-アルキルカルバモイル-(C₁-C₄)-アルキル、(C₂-C₄)-アルケニルカルバモイル-(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ-(C₁-C₄)-アルキル、ジオキサソラニル-(C₁-C₄)-アルキル、チアゾリル、フリル、フリルアルキル、チエニル、ピペリジルを表すか、又は、置換されているか若しくは置換されていないフェニルを表すか、又は、R_C²とR_C³は一緒に、置換されているか若しくは置換されていないヘテロ環式環(好ましくは、オキサゾリジン環、チアゾリジン環、ピペリジン環、モルホリン環、ヘキサヒドロピリミジン環又はベンゾオキサジン環)を形成している]

で表される化合物;

好ましくは:

発生前薬害軽減剤(土壌作用性薬害軽減剤)としてしばしば使用されるジクロロアセトアミドのタイプの活性化化合物、例えば、「ジクロロミド」(N,N-ジアリル-2,2-ジクロロアセトアミド)(S3-1)、「R-29148」(3-ジクロロアセチル-2,2,5-トリメチル-1,3-オキサゾリジン)[供給元:Stauf fer](S3-2)、「R-28725」(3-ジクロロアセチル-2,2-ジメチル-1,3-オキサゾリジン)[供給元:Stauf fer](S3-3)、「ベノキサコル」(4-ジクロロアセチル-3,4-ジヒドロ-3-メチル-2H-1,4-ベンゾオキサジン)(S3-4)、「PPG-1292」(N-アリル-N-[(1,3-ジオキサラン-2-イル)メチル]ジクロロアセトアミド)[供給元:PPG Industries](S3-5)、「DKA-24」(N-アリル-N-[(アリルアミノカルボニル)メチル]ジクロロアセトアミド)[供給元:Sagro-Chem](S3-6)、「AD-67」又は「MON 4660」(3-ジクロロアセチル-1-オキサ-3-アザスピロ[4.5]デカン)[供給元:Nitrokemia、又は、Monsanto](S3-7)、「TI-35」(1-ジクロロアセチルアゼパン)[供給元:TRI-Chemical RT](S3-8)、「ジクロノン(diclonon)」(ジシクロノン)又は「BAS 145138」又は「LAB 145138」(S3-9)、((RS)-1-ジクロロアセチル-3,3,8a-トリメチルペルヒドロピロロ[1,2-a]ピリミジン-6-オン)[供給元:Basf]、「フリラゾール」又は「MON 13900」((RS)-3-ジクロロアセチル-5-(2-フリル)-2,2-ジメチルオキサゾリジン)(S3-10)及びその(R)-異性体(S3-11)。

【0112】

(S4) 式(S4)

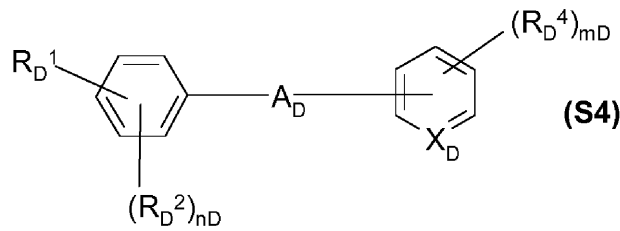
20

30

40

50

【化 17】



10

【0113】

〔式中、記号及び添え字は、以下のように定義される：

A_D は、 $SO_2 - NR_D^3 - CO$ 又は $CO - NR_D^3 - SO_2$ を表し；

X_D は、 CH 又は N を表し；

R_D^1 は、 $CO - NR_D^5 R_D^6$ 又は $NHCO - R_D^7$ を表し；

R_D^2 は、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、ニトロ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシカルボニル又は $(C_1 - C_4)$ - アルキルカルボニルを表し；

R_D^3 は、水素、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_2 - C_4)$ - アルケニル又は $(C_2 - C_4)$ - アルキニルを表し；

20

R_D^4 は、ハロゲン、ニトロ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - ハロアルコキシ、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、フェニル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシカルボニル又は $(C_1 - C_4)$ - アルキルカルボニルを表し；

R_D^5 は、水素、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル、 $(C_5 - C_6)$ - シクロアルケニル、フェニル又は 3 ~ 6 員のヘテロシクリル（ここで、該ヘテロシクリルは、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される v_D 個のヘテロ原子を含んでいる）を表し（ここで、最後に挙げられている 7 つのラジカルは、ハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_2)$ - アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_2)$ - アルキルスルホニル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルカルボニル及びフェニルからなる群から選択される、また、環式ラジカルの場合には、さらに、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル及び $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルからなる群からも選択される、 v_D の置換基で置換されている）；

30

R_D^6 は、水素、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル又は $(C_2 - C_6)$ - アルキニルを表し（ここで、最後に挙げられている 3 つのラジカルは、ハロゲン、ヒドロキシ、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ及び $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオからなる群から選択される v_D のラジカルで置換されている）；又は、 R_D^5 と R_D^6 は、それらを有している窒素原子と一緒に、ピロリジニルラジカル又はピペリジニルラジカルを形成しており；

40

R_D^7 は、水素、 $(C_1 - C_4)$ - アルキルアミノ、ジ - $(C_1 - C_4)$ - アルキルアミノ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキルを表し（ここで、最後に挙げられている 2 つのラジカルは、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルコキシ及び $(C_1 - C_4)$ - アルキルチオからなる群から選択される、また、環式ラジカルの場合には、さらに、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル及び $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルからなる群からも選択される、 v_D の置換基で置換されている）；

n_D は、0、1 又は 2 を表し；

m_D は、1 又は 2 を表し；

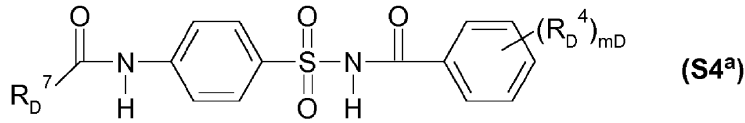
50

v_D は、0、1、2 又は 3 を表す]

で表される N - アシルスルホンアミド及びそれらの塩；

これらの中で、例えば、WO - A - 97 / 45016 から知られている、例えば、下記式 (S4a)

【化18】



10

【0114】

[式中、

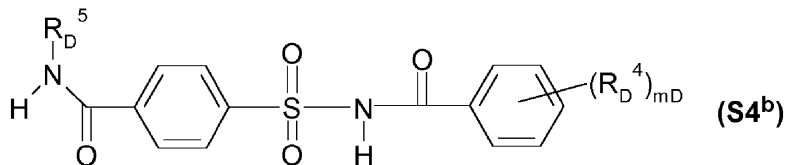
R_D^7 は、(C₁ - C₆) - アルキル又は (C₃ - C₆) - シクロアルキルであり (ここで、最後に挙げられている 2 つのラジカルは、ハロゲン、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシ及び (C₁ - C₄) - アルキルチオからなる群から選択される、また、環式ラジカルの場合には、さらに、(C₁ - C₄) - アルキル及び (C₁ - C₄) - ハロアルキルからなる群からも選択される、 v_D の置換基で置換されている)；
 R_D^4 は、ハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ又は CF₃ を表し；

m_D は、1 又は 2 を表し；

v_D は、0、1、2 又は 3 を表す]

で表される N - アシルスルホンアミドのタイプの化合物が好ましく、及び、例えば、WO - A - 99 / 16744 から知られている、例えば、下記式 (S4b)

【化19】



30

【0115】

で表されるアシルスルファモイルベンズアミド、例えば、上記式において、

R_D^5 = シクロプロピル、且つ、(R_D^4) = 2 - OMe (「シプロスルファミド」、S4 - 1)；

R_D^5 = シクロプロピル、且つ、(R_D^4) = 5 - Cl - 2 - OMe (S4 - 2)；

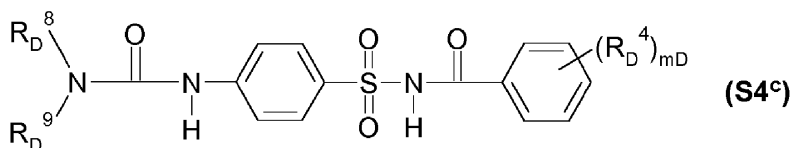
R_D^5 = エチル、且つ、(R_D^4) = 2 - OMe (S4 - 3)；

R_D^5 = イソプロピル、且つ、(R_D^4) = 5 - Cl - 2 - OMe (S4 - 4)；及び、

R_D^5 = イソプロピル、且つ、(R_D^4) = 2 - OMe (S4 - 5)；

であるものなども好ましく、及び、例えば、EP - A - 365484 から知られている、下記式 (S4c)

【化20】



【0116】

[式中、

R_D^8 及び R_D^9 は、互いに独立して、水素、(C₁ - C₈) - アルキル、(C₃ - C₈

50

) - シクロアルキル、(C₃ - C₆) - アルケニル又は(C₃ - C₆) - アルキニルを表し；

R_D⁴ は、ハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、CF₃を表し；、

m_D は、1又は2を表す]

で表される N - アシルスルファモイルフェニル尿素のタイプの化合物、例えば、

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

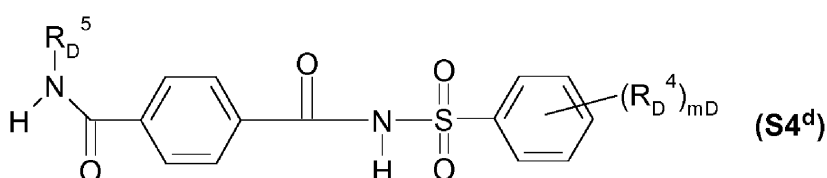
1 - [4 - (N - 2 - メトキシベンゾイルスルファモイル) フェニル] - 3 , 3 - ジメチル尿素；

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

10

なども好ましく、及び、例えば、CN 101838227 から知られている、式(S4^d)

【化21】



20

【0117】

で表される N - フェニルスルホニルテレフタルアミド、例えば、上記式中、

R_D⁴ が、ハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、CF₃を表し；

m_D が、1又は2を表し；

R_D⁵ が、水素、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、(C₅ - C₆) - シクロアルケニルを表す；

N - フェニルスルホニルテレフタルアミドなども好ましい。

【0118】

30

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

【0119】

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

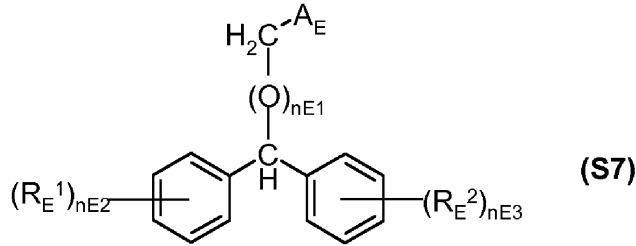
40

【0120】

(S7) 式(S7)(これは、WO - A - 1998 / 38856に記載されている)

50

【化22】



10

【0121】

〔式中、記号及び添え字は、以下のように定義される：

R_{E1} 、 R_{E2} は、互いに独立して、ハロゲン、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルキルアミノ、ジ-(C₁-C₄)-アルキルアミノ、ニトロを表し；

A_E は、COOR_{E3} 又は COSR_{E4} を表し；

R_{E3} 、 R_{E4} は、互いに独立して、水素、(C₁-C₄)-アルキル、(C₂-C₆)-アルケニル、(C₂-C₄)-アルキニル、シアノアルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、フェニル、ニトロフェニル、ベンジル、ハロベンジル、ピリジニルアルキル及びアルキルアンモニウムを表し；

20

n_{E1} は、0又は1を表し；

n_{E2} 、 n_{E3} は、互いに独立して、0、1又は2を表す〕

で表される化合物；

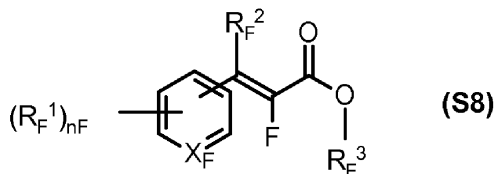
好ましくは：

ジフェニルメトキシ酢酸、ジフェニルメトキシ酢酸エチル、ジフェニルメトキシ酢酸メチル (CAS Reg. No. 41858-19-9) (S7-1)。

【0122】

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

【化23】



30

【0123】

〔式中、

X_F は、CH又はNを表し；

n_F は、 $X_F = N$ である場合、0～4の整数であり；及び、

40

n_F は、 $X_F = CH$ である場合、0～5の整数であり；

R_{F1} は、ハロゲン、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ、ニトロ、(C₁-C₄)-アルキルチオ、(C₁-C₄)-アルキルスルホニル、(C₁-C₄)-アルコキシカルボニル、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよいフェノキシを表し；

R_{F2} は、水素又は(C₁-C₄)-アルキルを表し；

R_{F3} は、水素、(C₁-C₈)-アルキル、(C₂-C₄)-アルケニル、(C₂-C₄)-アルキニル又はアリール(ここで、上記炭素含有ラジカルは、それぞれ、置換されていないか、又は、ハロゲン及びアルコキシからなる群から選択される1以上の(好ましくは、最大で3までの)同一であるか若しくは異なっているラジカルで置換されている)

50

を表す]

で表される化合物又はその塩；

好ましくは、上記式中、

X_F が、 CH を表し；

n_F が、0 ~ 2の整数を表し；

R_F^1 が、ハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシを表し；

R_F^2 が、水素又は(C₁ - C₄) - アルキルを表し；

R_F^3 が、水素、(C₁ - C₈) - アルキル、(C₂ - C₄) - アルケニル、(C₂ - C₄) - アルキニル又はアリール(ここで、上記炭素含有ラジカルは、それぞれ、置換されていないか、又は、ハロゲン及びアルコキシからなる群から選択される1以上の(好ましくは、最大で3までの)同一であるか若しくは異なっているラジカルで置換されている)

を表す；

化合物又はその塩。

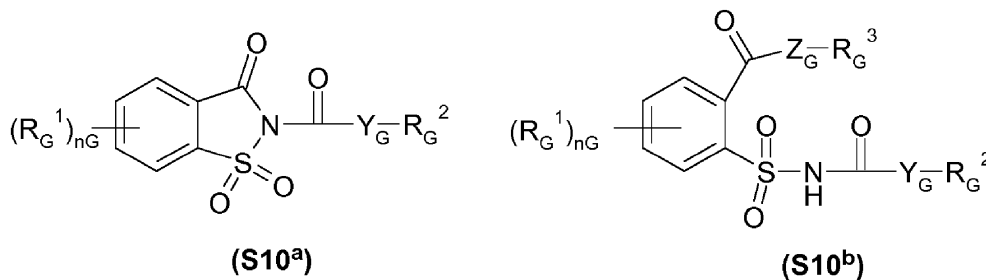
【0124】

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

【0125】

(S₁₀) 式(S_{10a})又は式(S_{10b})(これらは、WO - A - 2007 / 0237190及びWO - A - 2007 / 023764に記載されている)

【化24】



【0126】

[式中、

・ R_G^1 は、ハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、メトキシ、ニトロ、シアノ、 CF_3 、 OCF_3 を表し；

・ Y_G 、 Z_G は、互いに独立して、O又はSを表し；

・ n_G は、0 ~ 4の整数を表し；

R_G^2 は、(C₁ - C₁₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、アリール、ベンジル、ハロベンジルを表し；

R_G^3 は、水素又は(C₁ - C₆) - アルキルを表す]

で表される化合物。

【0127】

(S₁₁) オキシイミノ化合物のタイプの活性化合物(S₁₁)(これらは、種子粉衣剤として知られている)、例えば、

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

10

20

30

40

50

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

「シオメトリニル」又は「CGA-43089」((Z)-シアノメトキシイミノ(フェニル)アセトニトリル)(S11-3)(これは、メトラクロールによる損傷に対するアワ/モロコシ用の種子粉衣薬害軽減剤として知られている)。

【0128】

(S12) イソチオクロマノン類の類から選択される活性化合物(S12)、例えば、[(3-オキソ-1H-2-ベンゾチオピラン-4(3H)-イリデン)メトキシ]酢酸メチル(CAS Reg. No. 205121-04-6)(S12-1)及び関連化合物(WO-A-1998/13361)。

10

【0129】

(S13) 以下の群から選択される1種類以上の化合物(S13)：

「ナフタル酸無水物」(1,8-ナフタレンジカルボン酸無水物)(S13-1)(これは、チオカーバメート系除草剤による損傷に対するトウモロコシ用の種子粉衣薬害軽減剤として知られている)；

「フェンクロリム」(4,6-ジクロロ-2-フェニルピリミジン)(S13-2)(これは、播種されたイネにおいてプレチラクロールに対する薬害軽減剤として知られている)；

20

「フルラゾール」(2-クロロ-4-トリフルオロメチル-1,3-チアゾール-5-カルボン酸ベンジル)(S13-3)(これは、アラクロール及びメトラクロールによる損傷に対するアワ、ソルガム用の種子粉衣薬害軽減剤として知られている)；

「CL 304415」(CAS Reg. No. 31541-57-8)(4-カルボキシ-3,4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾピラン-4-酢酸)(S13-4)[供給元：American Cyanamid](これは、イミダゾリノン類による損傷に対するトウモロコシ用の薬害軽減剤として知られている)；

「MG 191」(CAS Reg. No. 96420-72-3)(2-ジクロロメチル-2-メチル-1,3-ジオキソラン)(S13-5)[供給元：Nitrokemia](これは、トウモロコシ用の薬害軽減剤として知られている)；

30

「MG 838」(CAS Reg. No. 133993-74-5)(2-プロベニル1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン-4-カルボジチオエート)(S13-6)[供給元：Nitrokemia]；

「ジスルホトン」(O,O-ジエチル S-2-エチルチオエチル ホスホロジチオエート)(S13-7)；

「ジエトレート(dietholate)」(O,O-ジエチル O-フェニルホスホロチオエート)(S13-8)；

「メフェネート(mephenate)」(メチルカルバミン酸4-クロロフェニル)(S13-9)。

【0130】

40

(S14) 有害な植物に対する除草効果に加えてイネなどの作物植物に対する薬害軽減効果も有している活性化合物、例えば、

「ジメピレート」又は「MY 93」(S-1-メチル 1-フェニルエチルピペリジン-1-カルボチオエート)(これは、除草剤モリネートによる損傷に対するイネ用の薬害軽減剤として知られている)；

「ダイムロン」又は「SK 23」(1-(1-メチル-1-フェニルエチル)-3-p-トリル尿素)(これは、イマゾスルフロン除草剤による損傷に対するイネ用の薬害軽減剤として知られている)；

「クミルロン」=「JC 940」(3-(2-クロロフェニルメチル)-1-(1-メチル-1-フェニルエチル)尿素；JP-A-60087254を参照されたい)(これ

50

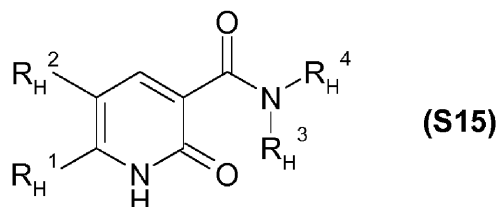
は、一部の除草剤による損傷に対するイネ用の薬害軽減剤として知られている) ;
「メトキシフェノン」又は「NK 049」(3,3'-ジメチル-4-メトキシベンゾフェノン)(これは、一部の除草剤による損傷に対するイネ用の薬害軽減剤として知られている) ;

「CSB」(1-ブロモ-4-(クロロメチルスルホニル)ベンゼン)[供給元: Kumiai](CAS Reg. No. 54091-06-4)(これは、イネにおける一部の除草剤による損傷に対する薬害軽減剤として知られている)。

【0131】

(S15) 式(S15)(これは、WO-A-2008/131861及びWO-A-2008/131860に記載されている)

【化25】



【0132】

[式中、

R_H^1 は、(C₁-C₆)-ハロアルキルラジカルを表し；及び、

R_H^2 は、水素又はハロゲンを表し；及び

R_H^3 、 R_H^4 は、互いに独立して、水素、(C₁-C₁₆)-アルキル、(C₂-C₁₆)-アルケニル若しくは(C₂-C₁₆)-アルキニルを表す(ここで、最後に挙げられている3つのラジカルは、それぞれ、置換されていないか、又は、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ、(C₁-C₄)-アルキルチオ、(C₁-C₄)-アルキルアミノ、ジ[(C₁-C₄)-アルキル]アミノ、[(C₁-C₄)-アルコキシ]カルボニル、[(C₁-C₄)-ハロアルコキシ]カルボニル、置換されていないか若しくは置換されている(C₃-C₆)-シクロアルキル、置換されていないか若しくは置換されているフェニル及び置換されていないか若しくは置換されているヘテロシクリルの群から選択される1以上のラジカルで置換されている)か、又は、(C₃-C₆)-シクロアルキル、(C₄-C₆)-シクロアルケニル、(C₃-C₆)-シクロアルキル(ここで、該シクロアルキルは、当該環の1辺において4~6員の飽和又は不飽和の炭素環式環に縮合している)若しくは(C₄-C₆)-シクロアルケニル(ここで、該シクロアルケニルは、当該環の1辺において4~6員の飽和又は不飽和の炭素環式環に縮合している)を表し(ここで、最後に挙げられている4つのラジカルは、それぞれ、置換されていないか、又は、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ、(C₁-C₄)-アルキルチオ、(C₁-C₄)-アルキルアミノ、ジ[(C₁-C₄)-アルキル]アミノ、[(C₁-C₄)-アルコキシ]カルボニル、[(C₁-C₄)-ハロアルコキシ]カルボニル、置換されていないか若しくは置換されている(C₃-C₆)-シクロアルキル、置換されていないか若しくは置換されているフェニル及び置換されていないか若しくは置換されているヘテロシクリルからなる群から選択される1以上のラジカルで置換されている)；

又は、

R_H^3 は、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₂-C₄)-アルケニルオキシ、(C₂-C₆)-アルキニルオキシ又は(C₂-C₄)-ハロアルコキシを表し；及び、

R_H^4 は、水素又は(C₁-C₄)-アルキルを表し；又は、

R_H^3 と R_H^4 は、直接結合している窒素原子と一緒に、4~8員のヘテロ環式環(ここ

10

20

30

40

50

で、該ヘテロ環式環は、当該窒素原子に加えて、さらなる環ヘテロ原子（好ましくは、N、O及びSの群から選択される最大で2個までのさらなる環ヘテロ原子）も含むことができ、また、該ヘテロ環式環は、置換されていないか、又は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ及び(C₁-C₄)-アルキルチオの群から選択される1以上のラジカルで置換されている)を表す)で表される化合物又はその互変異性体。

【0133】

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

(2,4-ジクロロフェノキシ)酢酸(2,4-D);

(4-クロロフェノキシ)酢酸;

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

4-(2,4-ジクロロフェノキシ)酪酸(2,4-DB);

(4-クロロ-*o*-トリルオキシ)酢酸(MCPA);

4-(4-クロロ-*o*-トリルオキシ)酪酸;

4-(4-クロロフェノキシ)酪酸;

3,6-ジクロロ-2-メトキシ安息香酸(ジカンバ);

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

【0134】

特に好ましい薬害軽減剤は、メフェンピル-ジエチル、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-メキシル及びジクロルミドである。

【0135】

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

【0136】

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

【0137】

散粉性製品(dusting products)は、該活性化合物を微粉碎された(finely distributed)固形物(例えば、タルク、自然粘土、例えば、カオリン、ベントナイト及び葉ろう石、又は、珪藻土)と一緒に粉碎することによって得られる。

10

20

30

40

50

【 0 1 3 8 】

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

【 0 1 3 9 】

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

【 0 1 4 0 】

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

【 0 1 4 1 】

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

【 0 1 4 2 】

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

【 0 1 4 3 】

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

【 0 1 4 4 】

該農薬調製物は、一般に、0.1～99重量%、特に、0.1～95重量%の、本発明の化合物を含んでいる。水和剤では、該活性化化合物の濃度は、例えば、約10重量%～90重量%であり、100重量%までの残余は、慣習的な製剤成分からなる。乳剤の場合は、該活性化化合物の濃度は、約1重量%～90重量%、好ましくは、5重量%～80重量%であり得る。粉末の形態にある製剤は、1重量%～30重量%の活性化化合物、好ましくは、通常、5重量%～20重量%の活性化化合物を含み；散布可能溶液剤は、約0.05重量%～80重量%、好ましくは、2重量%～50重量%の活性化化合物を含む。顆粒水和剤の場合は、該活性化化合物の含有量は、その活性化化合物が液体形態で存在しているか又は固体形態で存在しているかに部分的に依存し、及び、どのような造粒助剤、増量剤などが使用されるかに部分的に左右される。顆粒水和剤では、活性化化合物の含有量は、例えば、1重量%～95重量%、好ましくは、10重量%～80重量%である。

【 0 1 4 5 】

さらに、活性化化合物の上記製剤は、場合により、それぞれの慣習的な粘着剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、浸透剤、防腐剤、不凍剤、並びに、溶媒、増量剤、担体、並びに、色素、

10

20

30

40

50

消泡剤、蒸発抑制剤、並びに、pH及び粘度に影響を及ぼす作用剤を含有する。

【0146】

これらの製剤に基づいて、別の殺有害生物活性物質（例えば、殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、殺菌剤）との組合せ物や、さらにまた、薬害軽減剤、肥料及び/又は成長調節剤との組合せ物を、例えば、完成された製剤の形態で又はタンクミックスとして、製造することも可能である。

【0147】

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

10

【0148】

式(I)で表される化合物の必要とされる施用量は、外部条件（例えば、とりわけ、温度、湿度及び使用する除草剤の種類など）に応じて変わる。それは、広い範囲内で、例えば、0.001~1.0kg/ha又はそれ以上の活性物質の範囲内で、変わり得る。しかしながら、それは、好ましくは、0.005~750g/haである。

【0149】

担体は、特に植物又は植物の部分又は種子への施用に関して、適用性を良好にするために、当該活性化合物と混合させるか又は合する天然又は合成の有機物質又は無機物質である。このような担体は、固体又は液体であり得るが、一般に、不活性であり、そして、農業において使用するのに適しているべきである。

20

【0150】

有用な固体又は液体の担体としては、以下のものなどがある：例えば、アンモニウム塩、並びに、天然岩粉、例えば、カオリン、クレー、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイト又はケイ藻土、並びに、合成岩粉、例えば、微粉化シリカ、アルミナ及び天然又は合成のシリケート、樹脂、蠟、固形肥料、水、アルコール、特に、ブタノール、有機溶媒、鉱油及び植物油、並びに、それらの誘導体。そのような担体の混合物も使用し得る。粒剤に有用な固体担体としては、以下のものなどがある：例えば、粉碎して分別した天然岩石、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石、苦灰岩、並びに、無機及び有機の粗挽き粉からなる合成顆粒、並びに、さらに、有機材料、例えば、おがくず、ココナッツ殻、トウモロコシ穂軸及びタバコの葉柄などからなる顆粒。

30

【0151】

適切な液化ガス増量剤又は担体は、標準温度及び大気圧下では気体である液体、例えば、エアゾル噴射剤、例えば、ハロゲン化炭化水素類、又は、ブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素などである。

【0152】

上記製剤において、粘着付与剤、例えば、カルボキシメチルセルロース、粉末又は顆粒又はラテックスの形態にある天然ポリマー及び合成ポリマー、例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニル、又は、天然のリン脂質、例えば、セファリン及びレシチン、及び、合成リン脂質などを使用することができる。さらなる添加剤は、鉱油及び植物油であり得る。

40

【0153】

使用する増量剤が水である場合、例えば、有機溶媒を補助溶媒として使用することもできる。適切な液体溶媒は、本質的に、以下のものである：芳香族化合物、例えば、キシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族化合物及び塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン類、クロロエチレン類又はジクロロメタン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサン又はパラフィン類、例えば、鉱油留分、鉱油及び植物油、アルコール類、例えば、ブタノール又はグリコールとそれらのエーテル及びエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えば、ジメチルホルムアミド及びジメチルスルホキシド、及び、さらに

50

、水。

【0154】

本発明の組成物には、付加的に、さらなる成分（例えば、界面活性剤など）も含有させることができる。有用な界面活性剤は、イオン特性若しくは非イオン特性を有する乳化剤及び/若しくは泡形成剤、分散剤又は湿潤剤であるか、又は、そのような界面活性剤の混合物である。これらの例は、以下のものである：ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸若しくはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールの重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪酸の重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪アミンの重縮合物、置換されているフェノール（好ましくは、アルキルフェノール又はアリールフェノール）、スルホコハク酸エステル塩、タウリン誘導體（好ましくは、アルキルタウレート）、ポリエトキシ化アルコールのリン酸エステル若しくはポリエトキシ化フェノールのリン酸エステル、ポリオール脂肪酸エステル、並びに、硫酸アニオン、スルホン酸アニオン及びリン酸アニオンを含んでいる該化合物の誘導體、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリールスルホネート類、タンパク質加水分解物、リグノスルファイト廃液及びメチルセルロースなど。該活性化化合物のうちの1種類及び/又は該不活性担体のうちの1種類が水不溶性であり且つ施用が水で行われる場合は、界面活性剤を存在させることが必要である。界面活性剤の割合は、本発明組成物の5重量%～40重量%である。着色剤、例えば、無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタン及びプルシアンブルー（Prussian Blue）、並びに、有機染料、例えば、アリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、並びに、微量栄養素、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などを使用することができる。

【0155】

適切な場合には、付加的な別の成分、例えば、保護コロイド、結合剤、粘着剤、増粘剤、揺変性物質、浸透剤、安定化剤、金属イオン封鎖剤、錯化剤なども存在させることができる。一般に、該活性化化合物は、製剤目的で一般的に使用される固体又は液体の任意の添加剤と組み合わせることが可能である。一般に、本発明による組成物及び製剤は、0.05～99重量%、0.01～98重量%、好ましくは、0.1～95重量%、及び、さらに好ましくは、0.5～90重量%の活性化化合物を含有し、最も好ましくは、10～70重量%の活性化化合物を含有する。本発明による活性化化合物又は組成物は、そのまま使用することが可能であるか、又は、それらの個々の物理的及び/若しくは化学的特性に応じて、以下のようなそれらの製剤の形態若しくはその製剤から調製される使用形態で使用することが可能である：エーロゾル剤、カプセル懸濁液剤、冷煙霧濃厚剤（cold-fogging concentrate）、温煙霧濃厚剤（warm-fogging concentrate）、カプセル化粒剤、細粒剤、種子処理用フロアブル剤、即時使用可能な溶液剤（ready-to-use solution）、散粉性粉剤、乳剤、水中油型エマルジョン剤、油中水型エマルジョン剤、大型粒剤、微粒剤、油分散性粉剤、油混和性フロアブル剤、油混和性液剤、泡剤（foam）、ペースト剤、農薬粉衣種子、懸濁製剤（suspension concentrate）、サスポエマルジョン製剤、可溶性濃厚剤（soluble concentrate）、懸濁液剤（suspension）、水和剤、可溶性粉剤（soluble powder）、粉剤及び粒剤、水溶性顆粒剤又は錠剤、種子処理用水溶性粉剤、水和剤、活性化化合物が含浸されている天然生成物及び合成物質、並びに、さらに、ポリマー物質中にマイクロカプセル化されているもの及び種子用のコーティング物質中にマイクロカプセル化されているもの、並びに、さらに、ULV冷煙霧製剤（ULV cold-fogging formulation）及びULV温煙霧製剤（ULV warm-fogging formulation）。

【0156】

上記製剤は、自体公知の方法で、例えば、当該活性化化合物を少なくとも1種類の慣習的な増量剤、溶媒又は希釈剤、乳化剤、分散剤及び/又は結合剤又は固着剤、湿潤剤、撥水剤、場合により、乾燥剤及び紫外線安定剤、並びに、場合により、染料及び顔料、消泡剤、

防腐剤、第2の増粘剤、粘着性付与剤、ジベレリン類、並びに、さらに、別の加工助剤と混合させることによって、製造することができる。

【0157】

本発明による組成物には、既に使用し得る状態にあつて適切な装置を用いて植物又は種子に対して使用可能な製剤のみではなく、使用前に水で希釈することが必要な商業的な濃厚物も包含される。

【0158】

本発明による活性化合物は、それだけで存在し得るか、又は、その（商業用の標準的な）製剤中に、若しくは、そのような製剤から調製された使用形態中に、殺虫剤、誘引剤、不妊剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、成長調節剤、除草剤、肥料、薬害軽減剤若しくは情報化学物質などの別の（既知）活性化合物との混合物として、存在し得る。

10

【0159】

上記活性化合物又は組成物を用いた植物及び植物の部分の本発明による処理は、慣習的な処理方法を用いて、例えば、浸漬、散布、噴霧、灌漑、気化、散粉、煙霧、ばらまき、泡状化、塗布、拡散（spreading-on）、灌水（灌漑（drenching））、点滴灌漑などによって、直接的に行うか、又は、該活性化合物又は組成物を植物及び植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることにより行い、また、繁殖器官（propagation material）の場合、特に種子の場合には、さらに、乾式種子処理用の粉末として、種子処理用の溶液として、スラリー処理用の水溶性粉末として、外被化（incrusting）によって、1層以上の被膜をコーティングすることによっても行う。さらに、該活性化合物を微量散布法（ultra-low volume method）によって施用することも可能であり、又は、該活性化合物調製物若しくは該活性化合物自体を土壌中に注入することも可能である。

20

【0160】

以下でも記載されているように、本発明の化合物又は組成物によるトランスジェニック種子の処理は、特に重要である。このことは、殺虫特性を有するポリペプチド又はタンパク質の発現を可能にする少なくとも1種類の異種遺伝子を含んでいる植物の種子に関連する。トランスジェニック種子内の異種遺伝子は、例えば、バシルス（*Bacillus*）種、リゾビウム（*Rhizobium*）種、シュードモナス（*Pseudomonas*）種、セラチア（*Serratia*）種、トリコデルマ（*Trichoderma*）種、クラビバクテル（*Clavibacter*）種、グロムス（*Glomus*）種又はグリオクラジウム（*Gliocladium*）種の微生物に由来し得る。この異種遺伝子は、好ましくは、バシルス属種（*Bacillus* sp.）に由来し、その場合、その遺伝子産物は、アワノメイガ（European corn borer）及び/又はウェスタンコーンルートワーム（Western corn rootworm）に対して有効である。該異種遺伝子は、さらに好ましくは、バシルス・ツリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）に由来する。

30

【0161】

本発明に関連して、本発明による組成物は、種子に対して、単独で施用するか、又は、適切な製剤中に含ませて施用する。好ましくは、種子は、処理の過程で損傷が起こらないように、十分に安定な状態で処理する。一般に、種子は、収穫と播種の間任意の時点で処理することができる。慣習的には、植物から分離されていて、穂軸、殻、葉柄、外皮、被毛又は果肉を伴っていない種子を使用する。例えば、収穫され、不純物が取り除かれ、含水量が15重量%未満となるまで乾燥された種子を使用することができる。あるいは、乾燥後に例えば水で処理され、その後再度乾燥された種子を使用することもできる。

40

【0162】

一般に、種子を処理する場合、種子の発芽が損なわれないように、及び、種子から生じる植物が損傷を受けないように、種子に施用する本発明組成物の量及び/又はさらなる添加剤の量を選択することに関して確実にしなければならない。このことは、特に、特定の施用量で薬害作用を示し得る活性化合物の場合には、確実にしなくてはならない。

50

【0163】

本発明の組成物は、直接的に施用することが、即ち、別の成分を含ませることなく、また、希釈することなく、施用することが可能である。一般に、該組成物は、適切な製剤の形態で種子に施用するのが好ましい。種子を処理するための適切な製剤及び方法は、当業者には知られており、そして、例えば、以下の文献に記載されている：US 4, 272, 417A、US 4, 245, 432A、US 4, 808, 430、US 5, 876, 739、US 2003/0176428A1、WO 2002/080675A1、WO 2002/028186A2。

【0164】

本発明に従って使用することが可能な活性化合物は、慣習的な種子粉衣製剤、例えば、溶液剤、エマルジョン剤、懸濁液剤、粉末剤、泡剤、スラリー剤又は種子用の別のコーティング組成物などに、及び、さらに、ULV製剤などに、変換することができる。

10

【0165】

これらの製剤は、既知方法で、活性化合物を、慣習的な添加剤、例えば、慣習的な増量剤、及び、溶媒又は希釈剤、着色剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、防腐剤、第2の増粘剤、粘着剤、ジベレリン類などと混合させ、及び、さらに、水と混合させることによって、製造する。

【0166】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤中に存在させることができる着色剤は、そのような目的に関して慣習的な全ての着色剤である。水中であまり溶解しない顔料と水中で溶解する染料のいずれも使用することができる。その例としては、「Rhodamin B」、「C.I. Pigment Red 112」及び「C.I. Solvent Red 1」の名称で知られている着色剤などを挙げるることができる。

20

【0167】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤中に存在させることができる有用な湿潤剤は、農薬活性化合物の製剤に関して慣習的な、湿潤を促進する全ての物質である。好ましくは、アルキルナフタレンスルホネート類、例えば、ジイソプロピルナフタレンスルホネート又はジイソブチルナフタレンスルホネートなどを使用する。

【0168】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤中に存在させることができる適切な分散剤及び/又は乳化剤は、農薬活性化合物の製剤に関して慣習的な非イオン性、アニオン性及びカチオン性の全ての分散剤である。好ましくは、非イオン性若しくはアニオン性の分散剤又は非イオン性若しくはアニオン性の分散剤の混合物を使用する。適している非イオン性分散剤としては、特に、エチレンオキシド/プロピレンオキシドブロックコポリマー類、アルキルフェノールポリグリコールエーテル類及びトリステチルフェノールポリグリコールエーテル類、並びに、それらのリン酸化誘導体又は硫酸化誘導体などを挙げるることができる。適しているアニオン性分散剤は、特に、リグノスルホネート類、ポリアクリル酸塩類及びアリアルスルホネート-ホルムアルデヒド縮合物である。

30

【0169】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤中に存在させることができる消泡剤は、農薬活性化合物の製剤に関して慣習的な全ての泡抑制物質である。好ましくは、シリコーン消泡剤及びステアリン酸マグネシウムを使用することができる。

40

【0170】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤中に存在させることができる防腐剤は、農薬組成物中で当該目的のために使用することが可能な全ての物質である。その例としては、ジクロロフェン及びベンジルアルコールヘミホルマールなどを挙げるることができる。

【0171】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤中に存在させることができる第2の増粘剤は、農薬組成物中で当該目的のために使用することが可能な全ての物質である。好ま

50

しい例としては、セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサンタン、変性クレー及び微粉碎シリカなどを挙げるができる。

【0172】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤中に存在させることができる有用な粘着剤は、種子粉衣剤中で使用可能な全ての慣習的な結合剤である。好ましい例としては、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール及びチロースなどを挙げるができる。

【0173】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤は、広い範囲の異なった種子（これは、トランスジェニック植物の種子を包含する）を処理するために、直接的に使用することが

10

【0174】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤又は水を添加することによってその種子粉衣剤から調製された調製物による種子の処理に関して、有用な装置は、種子粉衣に関して慣習的に使用可能な全ての混合装置である。具体的には、該種子粉衣手順は、種子を混合機の中に入れること、所望される特定量の種子粉衣剤を、そのままに添加するか又は予め水で希釈したあとに添加すること、及び、該剤が当該種子の表面に均質に分配されるまでそれらを混合させることである。適切な場合には、続いて乾燥工程を行う。

【0175】

本発明による活性化化合物は、植物が良好な適合性を示し、恒温動物に対する毒性が望ましい程度であり且つ環境との適合性が良好である場合、植物及び植物の器官を保護するのに適しており、収穫高を増大させるのに適しており、及び、収穫された作物の質を向上させるのに適している。それらは、好ましくは、作物保護剤として使用することができる。それらは、通常感受性種及び抵抗性種に対して活性を示し、また、全ての発育段階又は特定の発育段階に対して活性を示す。

20

【0176】

本発明に従って処理することが可能な植物としては、以下の主要な作物植物などを挙げる
ことができる：トウモロコシ、ダイズ、ワタ、アブラナ属油料種子（*Brassica oil seeds*）、例えば、セイヨウアブラナ（*Brassica napus*）（例
例えば、カノラ）、カブ（*Brassica rapa*）、カラシナ（*B. juncea*）
（例えば、（フィールド）マスタード）及びアビシニアガラシ（*Brassica carinata*）、イネ、コムギ、テンサイ、サトウキビ、エンバク、ライムギ、オオムギ、
アワ及びソルガム、ライコムギ、アマ、ブドウの木、並びに、種々の植物学的分類群に
属するさまざまな果実及び野菜、例えば、バラ科各種（*Rosaceae sp.*）（例
例えば、仁果類、例えば、リンゴ及びナシ、さらに、核果類、例えば、アンズ、サクラ、ア
ーモンド及びモモ、並びに、液果類、例えば、イチゴ）、リベシオイダエ科各種（*Ribesioideae sp.*）、クルミ科各種（*Juglandaceae sp.*）、カバ
ノキ科各種（*Betulaceae sp.*）、ウルシ科各種（*Anacardiaceae sp.*）、ブナ科各種（*Fagaceae sp.*）、クワ科各種（*Moraceae*
sp.）、モクセイ科各種（*Oleaceae sp.*）、マタタビ科各種（*Actinidaceae sp.*）、クスノキ科各種（*Lauraceae sp.*）、バショウ
科各種（*Musaceae sp.*）（例えば、バナナの木及びプランテーション）、アカネ科各種（*Rubiaceae sp.*）（例えば、コーヒー）、ツバキ科各種（*Theaceae sp.*）、アオギリ科各種（*Sterculiaceae sp.*）、ミカン
科各種（*Rutaceae sp.*）（例えば、レモン、オレンジ及びグレープフルーツ）；ナス科各種（*Solanaceae sp.*）（例えば、トマト、ジャガイモ、トウ
ガラシ、ナス）、ユリ科各種（*Liliaceae sp.*）、キク科各種（*Compositae sp.*）（例えば、レタス、チョウセンアザミ及びチコリー（これは、ルー
トチコリー（*root chicory*））、エンダイブ又はキクニガナ（*common c*

30

40

50

h i c o r y) を包含する))、セリ科各種 (U m b e l l i f e r a e s p .) (例
 えば、ニンジン、パセリ、セロリ及びセルリアック)、ウリ科各種 (C u c u r b i t a
 c e a e s p .) (例えば、キュウリ (これは、ガーキンを包含する)、カボチャ、ス
 イカ、ヒョウタン及びメロン)、ネギ科各種 (A l l i a c e a e s p .) (例えば、
 リーキ及びタマネギ)、アブラナ科各種 (C r u c i f e r a e s p .) (例えば、白
 キャベツ、赤キャベツ、ブロッコリー、カリフラワー、芽キャベツ、タイサイ、コールラ
 ビ、ラディッシュ、セイヨウワサビ、コショウソウ及びハクサイ)、マメ科各種 (L e g
 u m i n o s a e s p .) (例えば、ラッカセイ、エンドウ及びインゲンマメ (例えば
 、インゲンマメ (c o m m o n b e a n) 及びソラマメ))、アカザ科各種 (C h e n
 o p o d i a c e a e s p .) (例えば、フダンソウ、飼料用ビート、ハウレンソウ、
 ビートルート)、アオイ科 (M a l v a c e a e) (例えば、オクラ)、クサスギカズラ
 科 (A s p a r a g a c e a e) (例えば、アスパラガス) ; 庭園及び森林における有用
 な植物及び観賞植物 ; 及び、いずれの場合にも、これら植物の遺伝子組み換えが行われた
 タイプのもの。

10

【 0 1 7 7 】

上記で述べたように、本発明に従って、全ての植物及びそれらの部分を処理することがで
 きる。好ましい実施形態では、野生の植物種及び植物品種、又は、交雑若しくはプロトプ
 ラスト融合のような慣習的な生物学的育種方法により得られた植物種及び植物品種、並び
 に、それらの部分を処理する。好ましいさらなる実施形態では、適切な場合には慣習的な
 方法と組み合わせた遺伝子工学的的方法により得られたトランスジェニック植物及び植物品
 種 (遺伝子組換え生物) 及びそれらの部分を処理する。用語「部分 (p a r t s) 」又は
 「植物の部分 (p a r t s o f p l a n t s) 」又は「植物の部分 (p l a n t p a
 r t s) 」については、上記で説明した。本発明に従って特に好ましいのは、商業上慣習
 的なそれぞれの植物品種の植物又は使用されているそれぞれの植物品種の植物を処理する
 ことである。植物品種は、慣習的な育種又は突然変異誘発又は組換え DNA 技術によって
 栽培された、新しい特性 (「形質」) を有する植物を意味するものと理解される。それら
 は、品種、変種、生物型又は遺伝子型であることができる。

20

【 0 1 7 8 】

本発明による処理方法は、遺伝子組換え生物 (G M O) 、例えば、植物又は種子などを処
 理するのに使用することができる。遺伝子組換え植物 (又は、トランスジェニック植物
) は、異種遺伝子がゲノムに安定的に組み込まれている植物である。用語「異種遺伝子」
 は、本質的に、供給されたか又は当該植物の外部で構築された遺伝子であって、核のゲノ
 ム、葉緑体のゲノム又はミトコンドリアのゲノムの中に導入されたときに、その遺伝子が
 興味深いタンパク質若しくはポリペプチドを発現することにより、又は、その植物体内に
 存在している別の 1 つ若しくは複数の遺伝子がダウンレギュレート若しくはスイッチオフ
 されることにより (例えば、アンチセンス技術、コサプレッション技術又は R N A i 技術
 [R N A 干渉] などを使用する) 、当該形質転換された植物に新しい又は改善された作物
 学的特性又は別の形質を付与する遺伝子を意味する。ゲノム内に存在している異種遺伝子
 は、導入遺伝子とも称される。植物ゲノム内におけるその特異的な存在によって定義され
 る導入遺伝子は、形質転換又は遺伝子導入イベントと称される。

30

40

【 0 1 7 9 】

植物種又は植物品種、それらの生育場所及び生育条件 (土壌、気候、生育期、養分 (d i
 e t)) に応じて、本発明の処理により、相加効果を超越する効果 (「相乗効果」) も生じ
 得る。例えば、実際に予期される効果を超越する以下の効果などが可能である : 本発明に従
 って使用し得る活性成分及び組成物の施用量の低減及び / 又は活性スペクトルの拡大及び
 / 又は効力の増強、植物の生育の向上、高温又は低温に対する耐性の向上、湯水又は水中
 若しくは土壌中に含まれる塩分に対する耐性の向上、開花能力の向上、収穫の容易性の向
 上、促進された成熟、収穫量の増加、果実の大きさの増大、植物の高さの増大、葉の緑色
 の向上、より早い開花、収穫された生産物の品質の向上及び / 又は栄養価の増加、果実内
 の糖度の上昇、収穫された生産物の貯蔵安定性の向上及び / 又は加工性の向上。

50

【0180】

本発明に従って処理するのが好ましい植物及び植物品種には、特に有利で有用な形質を植物に付与する遺伝物質を有している全ての植物（育種によって得られたものであろうと、及び/又は、生物工学的手段によって得られたものであろうと）が包含される。

【0181】

線虫抵抗性植物の例は、例えば、以下の米国特許出願に記載されている：11/765, 491、11/765, 494、10/926, 819、10/782, 020、12/032, 479、10/783, 417、10/782, 096、11/657, 964、12/192, 904、11/396, 808、12/166, 253、12/166, 239、12/166, 124、12/166, 209、11/762, 886、12/364, 335、11/763, 947、12/252, 453、12/209, 354、12/491, 396、及び、12/497, 221。

10

【0182】

本発明に従って処理し得る植物は、雑種強勢又は雑種効果（これは、結果として、一般に、増加した収量、向上した活力、向上した健康状態並びに生物的及び非生物的ストレス因子に対する向上した抵抗性をもたらす）の特性を既に呈しているハイブリッド植物である。そのような植物は、典型的には、雄性不稔交配母体近交系（*inbred male-sterile parent line*）（雌性交雑育種親）を別の雄性稔性交配母体近交系（*inbred male-fertile parent line*）（雄性交雑育種親）と交雑させることによって生成される。ハイブリッド種子は、典型的には、雄性不稔植物から収穫され、そして、栽培者に販売される。雄性不稔植物は、場合により（例えば、トウモロコシにおいて）、雄穂を除去することによって〔即ち、雄性繁殖器官又は雄花を機械的に除去することによって〕、作ることができる。しかしながら、より典型的には、雄性不稔性は、植物ゲノム内の遺伝的決定基の結果である。その場合、及び、特に種子がハイブリッド植物から収穫される所望の生産物である場合、典型的には、雄性不稔性に関与する遺伝的決定基を含んでいる該ハイブリッド植物において雄性稔性を確実に完全に回復させることは有益である。これは、雄性不稔性に関与する遺伝的決定基を含んでいるハイブリッド植物において雄性稔性を回復させることが可能な適切な稔性回復遺伝子を雄性交雑育種親が有していることを確実なものとすることによって達成することができる。雄性不稔性に関する遺伝的決定基は、細胞質内に存在させ得る。細胞質雄性不稔（CMS）の例は、例えば、アブラナ属各種（*Brassica species*）に関して記述された。しかしながら、雄性不稔性に関する遺伝的決定基は、核ゲノム内にも存在させ得る。雄性不稔性植物は、遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によっても得ることができる。雄性不稔性植物を得る特に有用な方法は、WO 89/10396に記載されており、ここでは、例えば、バルナーゼなどのリボヌクレアーゼを雄ずい内のタペータム細胞において選択的に発現させる。次いで、タペータム細胞内においてバルスターなどのリボヌクレアーゼインヒビターを発現させることによって、稔性を回復させることができる。

20

30

【0183】

本発明に従って処理し得る植物又は植物品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られたもの）は、除草剤耐性植物、即ち、1種類以上の所与の除草剤に対して耐性にされた植物である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、当該除草剤耐性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。

40

【0184】

除草剤耐性植物は、例えば、グリホセート耐性植物、即ち、除草剤グリホセート又はその塩に対して耐性にされた植物である。植物は、種々の方法によって、グリホセートに対して耐性にすることができる。かくして、例えば、グリホセート耐性植物は、酵素5-エノールピルビルシキミ酸-3-リン酸シンターゼ（EPSPS）をコードする遺伝子で植物を形質転換させることによって得ることができる。そのようなEPSPS遺伝子の例は、

50

以下のものである：細菌サルモネラ・チフィムリウム (*Salmonella typhimurium*) の AroA 遺伝子 (突然変異 CT7) (Comai et al., 1983, Science 221, 370-371)、細菌アグロバクテリウム属各種 (*Agrobacterium* sp.) の CP4 遺伝子 (Barry et al., 1992, Curr. Topics Plant Physiol. 7, 139-145)、ペチュニアの EPSPS をコードする遺伝子 (Shah et al., 1986, Science 233, 478-481)、トマトの EPSPS をコードする遺伝子 (Gasser et al., 1988, J. Biol. Chem. 263, 4280-4289) 又はオヒシバ属 (*Eleusine*) の EPSPS をコードする遺伝子 (WO 01/66704)。それは、突然変異 EPSPS であることも可能である。グリホセート耐性植物は、さらにまた、グリホセートオキシドレダクターゼ酵素をコードする遺伝子を発現させることによって得ることもできる。グリホセート耐性植物は、さらにまた、グリホセートアセチルトランスフェラーゼ酵素をコードする遺伝子を発現させることによって得ることもできる。グリホセート耐性植物は、さらにまた、上記遺伝子の自然発生突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることもできる。グリホセート耐性を付与する EPSPS 遺伝子を発現する植物は、既に記述されている。グリホセート耐性を付与する別の遺伝子 (例えば、デカルボキシラーゼ遺伝子) を発現する植物は、既に記述されている。

10

【0185】

別の除草剤抵抗性植物は、例えば、酵素グルタミンシンターゼを阻害する除草剤 (例えば、ピアラホス、ホスフィノトリシン又はグルホシネート) に対して耐性にされている植物である。そのような植物は、当該除草剤を解毒する酵素を発現させるか、又は、阻害に対して抵抗性を示す突然変異グルタミンシンターゼ酵素を発現させることによって、得ることができる。そのような有効な解毒酵素の1つの例は、ホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼをコードする酵素である (例えば、ストレプトミセス属各種 (*Streptomyces* species) に由来する *bar* タンパク質又は *pat* タンパク質)。外因性のホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼを発現する植物は、記述されている。

20

【0186】

さらなる除草剤耐性植物は、さらにまた、酵素ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ (HPPD) を阻害する除草剤に対して耐性にされている植物である。ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ類は、パラ-ヒドロキシフェニルピルベート (HPP) がホモゲンチセートに変換される反応を触媒する酵素である。HPPD 阻害薬に対して耐性を示す植物は、WO 96/38567、WO 99/24585、WO 99/24586、WO 2009/144079、WO 2002/046387 又は US 6,768,044 に記述されているように、自然発生抵抗性 HPPD 酵素をコードする遺伝子を用いて、又は、突然変異 HPPD 酵素若しくはキメラ HPPD 酵素をコードする遺伝子を用いて、形質転換させることができる。HPPD 阻害薬に対する耐性は、さらにまた、HPPD 阻害薬による天然 HPPD 酵素の阻害にもかかわらずホモゲンチセートを形成させることが可能な特定の酵素をコードする遺伝子を用いて植物を形質転換させることによっても得ることができる。そのような植物は、WO 99/34008 及び WO 02/36787 に記述されている。HPPD 阻害薬に対する植物の耐性は、さらにまた、WO 2004/024928 に記述されているように、HPPD 耐性酵素をコードする遺伝子に加えてプレフェナートデヒドロゲナーゼ酵素をコードする遺伝子を用いて植物を形質転換させることによって改善することもできる。さらに、植物は、そのゲノムの中に HPPD 阻害薬を代謝又は分解する酵素 (例えば、CYP450 酵素) をコードする遺伝子を挿入することによって、HPPD 阻害薬に対してさらに耐性にすることができる (WO 2007/103567 及び WO 2008/150473 を参照されたい)。

30

40

【0187】

別の除草剤抵抗性植物は、アセトラクテートシンターゼ (ALS) 阻害薬に対して耐性に

50

されている植物である。既知ALS阻害薬としては、例えば、スルホニル尿素系除草剤、イミダゾリノン系除草剤、トリアゾロピリミジン系除草剤、ピリミジニルオキシ(チオ)ベンゾエート系除草剤、及び/又は、スルホニルアミノカルボニルトリアゾリノン系除草剤などがある。ALS酵素(「アセトヒドロキシ酸シンターゼ(AHAS)」としても知られている)における種々の突然変異体は、例えば「Tranel and Wright (Weed Science 2002, 50:700-712)」などに記述されているように、種々の除草剤及び除草剤の群に対する耐性を付与することが知られている。スルホニル尿素耐性植物及びイミダゾリノン耐性植物の作製については、既に記述されている。さらなるスルホニル尿素耐性植物及びイミダゾリノン耐性植物についても、既に記述されている。

10

【0188】

イミダゾリノン類及び/又はスルホニル尿素類に対して耐性を示すさらなる植物は、誘導された突然変異誘発によって得ることができるか、当該除草剤の存在下での細胞培養における選抜によって得ることができるか、又は、突然変異育種によって得ることができる(c.f. 例えば、ダイズに関しては、US 5,084,082、イネに関しては、WO 97/41218、テンサイに関しては、US 5,773,702及びWO 99/057965、レタスに関しては、US 5,198,599、又は、ヒマワリに関しては、WO 01/065922)。

【0189】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種(遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られたもの)は、非生物的ストレス因子に対して耐性を示す。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、そのようなストレス抵抗性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。特に有用なストレス耐性植物としては、以下のものなどがある:

20

(a) 植物細胞内又は植物体内におけるポリ(ADP-リボース)ポリメラーゼ(PARP)遺伝子の発現及び/又は活性を低減させることが可能な導入遺伝子を含んでいる植物;

(b) 植物又は植物細胞のPARGコード化遺伝子の発現及び/又は活性を低減させることが可能なストレス耐性を強化する導入遺伝子を含んでいる植物;

(c) ニコチンアミダーゼ、ニコチン酸ホスホリボシルトランスフェラーゼ、ニコチン酸モノヌクレオチドアデニルトランスフェラーゼ、ニコチンアミドアデニンジヌクレオチドシンターゼ又はニコチンアミドホスホリボシルトランスフェラーゼを包含するニコチンアミドアデニンジヌクレオチドサルベージ合成経路の植物機能性酵素(plant-functional enzyme)をコードするストレス耐性を強化する導入遺伝子を含んでいる植物。

30

【0190】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種(遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られたもの)は、収穫された生産物の改変された量、品質及び/若しくは貯蔵安定性、並びに/又は、収穫された生産物の特定の成分の改変された特性を示す。例えば:

40

(1) 野生型の植物細胞又は植物において合成された澱粉と比較して、その物理化学的特性〔特に、アミロース含有量若しくはアミロース/アミロペクチン比、枝分かれ度、平均鎖長、側鎖分布、粘性挙動、ゲル化強度(gelling strength)、澱粉粒子サイズ及び/又は澱粉粒子形態〕が改変されていて、特定の用途により適した変性澱粉を合成するトランスジェニック植物;

(2) 非澱粉炭水化物ポリマーを合成するか、又は、遺伝子組換えがなされていない野生型植物と比較して改変された特性を有する非澱粉炭水化物ポリマーを合成する、トランスジェニック植物〔その例は、ポリフルクトース(特に、イヌリン型及びレバン型のポリフルクトース)を産生する植物、 α -1,4-グルカン類を産生する植物、 α -1,6-分枝 α -1,4-グルカン類を産生する植物、及び、アルテルナンを産生する植物であ

50

る) ;

(3) ヒアルロナンを産生するトランスジェニック植物 ;

(4) 「可溶性固形物高含有量」、「低辛味」(L P) 及び/又は「長期保存」(L S) などの特性を有するトランスジェニック植物又はハイブリッド植物、例えば、タマネギ。

【 0 1 9 1 】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種 (遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られたもの) は、改変された繊維特性を有する植物 (例えば、ワタ植物) である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、そのような改変された繊維特性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。そのような植物としては、以下のものなどがある :

10

(a) セルロースシンターゼ遺伝子の改変された形態を含んでいる植物 (例えば、ワタ植物) ;

(b) r s w 2 相同核酸又は r s w 3 相同核酸の改変された形態を含んでいる植物 (例えば、ワタ植物)、例えば、スクロースリン酸シンターゼの発現が増大しているワタ植物 ;

(c) スクロースシンターゼの発現が増大している植物 (例えば、ワタ植物) ;

(d) 繊維細胞に基づいた原形質連絡のゲーティングのタイミングが (例えば、繊維選択的 - 1 , 3 - グルカナーゼのダウンレギュレーションを介して) 改変されている植物 (例えば、ワタ植物) ;

(e) 反応性が (例えば、n o d C を包含する N - アセチルグルコサミントランスフェラーゼ遺伝子の発現及びキチンシンターゼ遺伝子の発現を介して) 改変されている繊維を有する植物 (例えば、ワタ植物) 。

20

【 0 1 9 2 】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種 (遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られたもの) は、改変されたオイルプロファイル特性を有する植物 (例えば、ナタネ植物又は関連するアブラナ属植物) である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、そのような改変されたオイル特性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。そのような植物としては、以下のものなどがある :

(a) オレイン酸含有量が高いオイルを産生する植物 (例えば、ナタネ植物) ;

(b) リノレン酸含有量が低いオイルを産生する植物 (例えば、ナタネ植物) ;

(c) 飽和脂肪酸のレベルが低いオイルを産生する植物 (例えば、ナタネ植物) 。

30

【 0 1 9 3 】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種 (遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得ることが可能なもの) は、ウイルス抵抗性を示す [例えば、ジャガイモウイルス Y に対してウイルス抵抗性を示す (S Y 2 3 0 イベント及び S Y 2 3 3 イベント、T e c n o p l a n t , A r g e n t i n a)] ジャガイモ又は病害 (例えば、ジャガイモ疫病) に対して抵抗性を示すジャガイモ (例えば、R B 遺伝子) 又は低減された低温誘発甘味を示すジャガイモ (これは、遺伝子 N t - I n h、遺伝子 I I - I N V を有している) 又は矮性表現型を示すジャガイモ (A - 2 0 オキシダーゼ遺伝子) などの植物である。

40

【 0 1 9 4 】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種 (遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られたもの) は、改変された種子脱粒特性を有する植物 (例えば、ナタネ植物又は関連するアブラナ属植物) である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、そのような改変された特性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。そのような植物としては、種子の脱粒が遅延されているか又は低減されている植物 (例えば、ナタネ植物) などがある。

【 0 1 9 5 】

本発明に従って処理し得る特に有用なトランスジェニック植物は、アメリカ合衆国内における規制除外 (n o n - r e g u l a t e d s t a t u s) についてのアメリカ合衆国

50

農務省 (U S D A) の動植物検疫局 (A P H I S) に対する認可申請又は継続申請の対象である、形質転換イベント又は形質転換イベントの組合せを含んでいる植物である。これに関連する情報は、A P H I S (4 7 0 0 R i v e r R o a d R i v e r d a l e , M D 2 0 7 3 7 , U S A) から、例えば、ウェブサイト「http://www.aphis.usda.gov/brs/not_reg.html」を介して、いつ何時でも入手することができる。本出願の出願日において、下記上方を有する申請は、A P H I S によって許可されたか又はA P H I S が審理中である：

- 申請： 当該申請の識別番号。形質転換イベントについての技術的な記述は、A P H I S からそのウェブサイトにおいて入手可能な特定の申請書類の中に、当該申請番号を介して見い出すことができる。それらの記述は、参照によって本明細書中に開示される。

10

【0196】

- 申請の拡張： 範囲又は期間の拡張が請求されている、先の申請についての言及。

【0197】

- 会社： 当該申請を提出している個人の名称。

【0198】

- 規制物： 当該植物種。

【0199】

- トランスジェニック表現型： 形質転換イベントによって植物に付与された形質。

【0200】

- 形質転換イベント又はライン： 規制除外が請求されている1つ又は複数のイベント(場合により、ラインとも称される)の名称。

20

【0201】

- A P H I S 文書： 申請に関連してA P H I S によって刊行されているか、又は、請求することでA P H I S から入手することが可能な、種々の文書。

【0202】

本発明に従って処理し得る特に有用なトランスジェニック植物は、1種類以上の毒素をコードする1種類以上の遺伝子を含んでいる植物、例えば、以下の商品名で販売されているトランスジェニック植物である：Y I E L D G A R D (登録商標)(例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ)、K n o c k O u t (登録商標)(例えば、トウモロコシ)、B i t e G a r d (登録商標)(例えば、トウモロコシ)、B T - X t r a (登録商標)(例えば、トウモロコシ)、S t a r L i n k (登録商標)(例えば、トウモロコシ)、B o l l g a r d (登録商標)(ワタ)、N u c o t n (登録商標)(ワタ)、N u c o t n 3 3 B (登録商標)(ワタ)、N a t u r e G a r d (登録商標)(例えば、トウモロコシ)、P r o t e c t a (登録商標)及びN e w L e a f (登録商標)(ジャガイモ)。除草剤耐性植物の例としては、以下の商品名で入手可能なトウモロコシ品種、ワタ品種及びダイズ品種などがある：R o u n d u p R e a d y (登録商標)(グリホセート類に対する耐性、例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ)、L i b e r t y L i n k (登録商標)(ホスフィトリシンに対する耐性、例えば、ナタネ)、I M I (登録商標)(イミダゾリノン系に対する耐性)及びS C S (登録商標)(スルホニル尿素系に対する耐性、例えば、トウモロコシ)。挙げることができる除草剤抵抗性植物(除草剤耐性に関して慣習的な方法で品種改良された植物)としては、商品名C l e a r f i e l d (登録商標)(例えば、トウモロコシ)で販売されている品種などがある。

30

40

【0203】

本発明に従って処理し得る特に有用なトランスジェニック植物は、形質転換イベント又は形質転換イベントの組合せを含んでいる植物であり、それらは、例えば、国又は地域のさまざまな規制機関に関するデータベースに記載されている〔例えば、「http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browser.aspx」及び「http://cera-gmc.org/index.php?evldcode=&hstIDXCcode=&gType=&AbbrCode=&atCode=&stCode=&coIDCcode=&action=gmo_crop_database&mode=Sub」〕

50

mit」を参照されたい}。

【実施例】

【0204】

A. 化学実施例

開示されている実施例のNMRデータは、慣習的な形態(値、水素原子の数、多重項分裂)で記載されているか、又は、所謂NMRピークリストとして記載されている。NMRピークリスト法では、選択された実施例のNMRデータは、NMRピークリストの形態で記載されており、ここで、各シグナルピークに対して、最初に値(ppm)が記載され、次に、スペースで区切られて、シグナル強度が記載されている。種々のシグナルピークに関する値/シグナル強度数の対が、セミコロンで互いに区切られて記載されている。

10

【0205】

従って、1つの例に対するピークリストは、以下の形態をとる：

1(強度1); 2(強度2); . . . ; i(強度i); . . . ; n(強度n)。

【0206】

先鋭なシグナルの強度は、NMRスペクトルの印刷された例におけるシグナルの高さ(cm)と相関し、シグナル強度の真の比率を示している。幅が広いシグナルの場合、数種類のピーク又は該シグナルの中央及びそれらの相対的強度が、当該スペクトルの中の最も強いシグナルとの比較で示され得る。

【0207】

^1H NMRスペクトルの化学シフトの較正は、テトラメチルシランを使用して実施するか、及び/又は、特にスペクトルがDMSO中で測定される場合には、その溶媒の化学シフトを使用して実施する。従って、NMRピークリストの中には、テトラメチルシランのピークは存在し得るが、必ずしも存在する必要はない。

20

【0208】

^1H NMRピークのリストは、従来の ^1H NMRのプリントアウトと類似しており、従って、通常、NMRの慣習的な解釈で記載される全てのピークを含んでいる。

【0209】

さらに、それらは、従来の ^1H NMRのプリントアウトのように、溶媒のシグナル、目標化合物の立体異性体(これも、同様に、本発明によって提供される)のシグナル及び/又は不純物のピークのシグナルも示し得る。

30

【0210】

溶媒及び/又は水のデルタ範囲内における化合物シグナルの記録において、 ^1H NMRピークの本発明者らによるリストは、標準的な溶媒のピーク、例えば、DMSO- D_6 中のDMSOのピーク及び水のピーク(これらは、通常、平均して高い強度を有している)を示している。

【0211】

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

【0212】

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

40

【0213】

^1H NMRピークリストに関するさらなる詳細については、「Research Disclosure Database Number 564025」の中に見いだすことができる。

【0214】

50

下記実施例によって、本発明について詳細に例証する。

【0215】

中間体1

3,5-ジフルオロ-N-ヒドロキシベンゼンカルボキシイミドイルクロリドの調製

3,5-ジクロロ-N-ヒドロキシベンゼンカルボキシイミドイルクロリドに関するWO2012/130798の手順と同様にして、3,5-ジフルオロ-N-ヒドロキシベンゼンカルボキシイミドイルクロリドを3,5-ジフルオロベンズアルデヒドから2段階で調製した。

【0216】

中間体2

3-(3,5-ジフルオロフェニル)-5-メチル-4H-イソキサゾール-5-カルボン酸メチルの調製

3-(3,5-ジフルオロフェニル)-5-メチル-4H-イソキサゾール-5-カルボン酸メチルに関するWO2012/130798の手順と同様にして、3-(3,5-ジフルオロフェニル)-5-メチル-4H-イソキサゾール-5-カルボン酸メチルを3,5-ジフルオロベンズアルデヒドから3段階で調製した。

【0217】

中間体3

3-(3,5-ジフルオロフェニル)-5-メチル-4H-イソキサゾール-5-カルボン酸の調製

3-(3,5-ジフルオロフェニル)-5-メチル-4H-イソキサゾール-5-カルボン酸に関するWO2012/130798の手順と同様にして、3-(3,5-ジフルオロフェニル)-5-メチル-4H-イソキサゾール-5-カルボン酸メチルを加水分解することによって3-(3,5-ジフルオロフェニル)-5-メチル-4H-イソキサゾール-5-カルボン酸を調製した。

【0218】

中間体4

3-(3,5-ジフルオロフェニル)-5-メチル-4H-イソキサゾール-5-カルボニルクロリドの調製

N-tert-ブチル-3-(3,5-ジフルオロフェニル)-5-メチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-カルボキサミドに関するWO2012/130798の手順と同様にして、3-(3,5-ジフルオロフェニル)-5-メチル-4H-イソキサゾール-5-カルボン酸から、塩化オキサニルとの反応によって、3-(3,5-ジフルオロフェニル)-5-メチル-4H-イソキサゾール-5-カルボニルクロリドを調製し、そして、それ以上精製することなく、粗製生成物として使用した。

【0219】

中間体5

3-(3,5-ジフルオロフェニル)-5-(1-ヒドロキシエチル)-4H-イソキサゾール-5-カルボン酸メチルの調製

19.9g(104mmol)の3,5-ジフルオロ-N-ヒドロキシベンゾイミドイルクロリド(中間体1を参照されたい)を330mLの2-プロパノールに溶解させ、15.0g(104mmol)の3-ヒドロキシ-2-メチレンブタン酸メチルを添加した。43.8g(522mmol)の重炭酸ナトリウムを添加した後、その懸濁液を50℃まで加熱し、そして、出発物質が完全に変換されるまで、その温度を2時間維持した。その懸濁液を濾過し、その濾液を減圧下で濃縮した。得られた残渣を取ってジクロロメタンの中に入れ、次いで、飽和塩化ナトリウム溶液で洗浄し、その有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、そして、濾過後、減圧下で濃縮した。そのようにして得られた粗製生成物を取ってトルエンの中に入れ、n-ヘプタンを添加することによって、結晶化させた。これによって、25.5g(86%)の3-(3,5-ジフルオロフェニル)-5-(1-ヒドロキシエチル)-4H-イソキサゾール-5-カルボン酸メチルが無色の結晶の形態で得ら

10

20

30

40

50

れた。

【0220】

ジステレオマー 1: $^1\text{H NMR (CDCl}_3\text{): } \delta = 1.20 \text{ (d, 3H), 2.36 (d, 1H), 3.52 (d, 1H), 3.72 (d, 1H), 3.83 (s, 3H), 4.34 (m, 1H), 6.88 (m, 1H), 7.20 (m, 2H).$

ジステレオマー 2: $^1\text{H NMR (CDCl}_3\text{): } \delta = 1.29 \text{ (d, 3H), 2.12 (d, 1H), 3.58 (d, 1H), 3.68 (d, 1H), 3.83 (s, 3H), 4.23 (m, 1H), 6.88 (m, 1H), 7.20 (m, 2H).$

中間体 6

3 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - [1 - (トリフルオロメチルスルホニルオキシ)エチル] - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸メチルの調製

660 mL のジクロロメタンの中の 29.9 (105 mmol) の 3 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - (1 - ヒドロキシエチル) - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸メチルを 0 まで冷却し、16.3 g (210 mmol) のピリジンを添加した。次いで、38.6 g (137 mmol) のトリフルオロメタンスルホン酸無水物を 80 mL のジクロロメタンに溶解させた溶液をゆっくりと添加した。0 で 30 分間経過した後、300 mL のジクロロメタンを添加し、その有機相を、毎回飽和塩化ナトリウム溶液と 1 N 塩酸からなる溶液 (3 : 1) 200 mL で 3 回洗浄した。次いで、その有機相を飽和塩化ナトリウム溶液で 2 回洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、そして、溶媒を減圧下で除去した。得られた粗製生成物は、それ以上精製することなく次の段階で使用した。

10

【0221】

ジステレオマー 1: $^1\text{H NMR (CDCl}_3\text{): } \delta = 1.54 \text{ (d, 3H), 3.44 (d, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.94 (d, 1H), 5.49 (q, 1H), 6.91 (m, 1H), 7.20 (m, 2H).$

ジステレオマー 2: $^1\text{H NMR (CDCl}_3\text{): } \delta = 1.59 \text{ (d, 3H), 3.53 (d, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.90 (d, 1H), 5.57 (q, 1H), 6.91 (m, 1H), 7.20 (m, 2H).$

20

中間体 7

3 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸メチルの調製

前の段階からの 43.0 g (103 mmol) の粗製生成物 (3 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - [1 - (トリフルオロメチルスルホニルオキシ)エチル] - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸メチル) を 500 mL のジメチルアセトアミドに溶解させ、18.8 g (124 mmol) の DBU を 50 mL のジメチルアセトアミドに溶解させた溶液を 20 分間かけて滴下して加えた。その反応混合物を室温で 2 時間攪拌し、次いで、1 L の氷冷 2 N 塩酸に注ぎ、毎回 500 mL のジエチルエーテルで 2 回抽出した。その有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、減圧下で濃縮した。移動相としてジクロロメタンを使用するシリカゲルクロマトグラフィー精製に付した後、その粗製生成物をシクロヘキサンから結晶化させた。これによって、23.4 g (85%) の無色の結晶が得られた。

30

【0222】

$^1\text{H NMR (CDCl}_3\text{): } \delta = 3.34 \text{ (d, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.93 (d, 1H), 5.38 (d, 1H), 5.55 (d, 1H), 6.14 (dd, 1H), 6.88 (m, 1H), 7.19 (m, 2H).$

中間体 8

3 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸の調製

21 mL の 2 N 水酸化ナトリウム水溶液を 7.5 g (28.0 mmol) の 3 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸メチルに添加し、その混合物を環流温度で 8 時間加熱した。冷却後、その反応混合物を酢酸エチルで洗浄し、その水相を 2 N 塩酸を用いて酸性化して pH 1 とし、そして、無色の沈澱物を濾過し、風乾させた。その収量は、6.8 g (96%) であった。

40

【0223】

$^1\text{H NMR (CDCl}_3\text{): } \delta = 3.40 \text{ (d, 1H), 3.92 (d, 1H), 5.00 (dd, 1H), 5.45 (d, 1H), 5.63 (d, 1H), 6.16 (dd, 1H), 6.87-6.93 (m, 1H), 7.16-7.21 (m, 2H).$

50

中間体 93 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニルクロリドの調製

2.70 g (10.6 mmol) の 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸を 45 mL のジクロロメタンに添加し、次いで、3 滴のジメチルホルムアミド (DMF) を添加し、その後、2.03 g (15.9 mmol) の塩化オキサリルを添加した。ガスの激しい発生が観察された。その混合物を室温で 6 時間攪拌し、次いで、溶媒及び過剰な塩化オキサリルを減圧下で蒸発させた。得られた粗製生成物は、それ以上精製することなく次の段階で使用した。

【 0 2 2 4 】

10

中間体 103 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 5 - メトキシ - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニルクロリドの調製

282 mg (0.97 mmol) の 3 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 5 - メトキシ - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸を 10 mL のジクロロメタンに添加し、次いで、3 滴のジメチルホルムアミド (DMF) を添加し、その後、少量のジクロロメタンに溶解させた 185 mg (1.85 mmol) の塩化オキサリルを添加した。その混合物を室温で 6 時間攪拌し、次いで、その反応混合物を減圧下で濃縮した。次いで、さらに 2 回、その残渣にジクロロメタンを添加し、その混合物を減圧下で濃縮した。得られた粗製生成物は、それ以上精製することなく次の段階で使用した。

20

【 0 2 2 5 】

中間体 114 - アミノ - 2 , 5 - ジヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルの調製

4 - アミノ - 2 , 5 - ジヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルは、F. Cohenら (J. Med. Chem. 2011, 54, 3426 - 3435) によって記載されている方法と同様にして、調製することができる。

【 0 2 2 6 】

中間体 124 - アミノ - 2 , 5 - ジヒドロフラン - 3 - カルボン酸エチルの調製

4 - アミノ - 2 , 5 - ジヒドロフラン - 3 - カルボン酸エチルは、F. Cohenら (J. Med. Chem. 2011, 54, 3426 - 3435) によって記載されている方法と同様にして、調製することができる。

30

【 0 2 2 7 】

中間体 134 - アミノテトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルの調製

4 - アミノテトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルは、G. R. Ottら (Bioorg. Med. Chem. Lett. 2008, 694 - 699) によって記載されている方法で調製することができる。

【 0 2 2 8 】

中間体 14

40

シス - 4 - アミノテトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチル塩酸塩の調製

シス - 4 - アミノテトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチル塩酸塩は、D. P. Walkerら (Synthesis 2011, 1113 - 1119) によって記載されている方法で調製することができる。

【 0 2 2 9 】

中間体 15N , N ' - ジイソプロピルカルバムイミド酸 tert - ブチルの調製

加熱することで乾燥させたフラスコの中で、窒素下、27 mg の無水塩化銅 (I) を 2.33 g の tert - ブタノールと 3.44 g の N , N ' - ジイソプロピルカルボジイミドに添加し、その混合物を室温で 2 時間攪拌し、そして、3 日間放置した。

50

【0230】

この粗製生成物は、そのままエステル化に使用して、tert-ブチルエステルが得られ、シリンジフィルターを用いて計量した。

【0231】

中間体16トランス-4-アミノテトラヒドロフラン-2-カルボン酸メチル塩酸塩の調製

トランス-4-アミノテトラヒドロフラン-2-カルボン酸メチル塩酸塩は、市販されているトランス-アミノカルボン酸から塩化チオニル/メタノールを用いたエステル化によって調製することができるが、又は、Allan, Robin D.; Tran, Hue W. (Australian Journal of Chemistry (1984), 37(5), 1123-6)によって記載されている方法で、市販されている2,5-アンヒドロ-3-デオキシペントン酸から調製することができる。

10

【0232】

中間体17(4S)-4-アミノ-4,5-ジヒドロフラン-2-カルボン酸メチルの調製

(4S)-4-アミノ-4,5-ジヒドロフラン-2-カルボン酸メチルは、Joseph P. Burkhardt, Gene W. Holbert, Brian W. Metcalf (Tetrahedron Lett., 25(46), 1984, pp. 5267-5270)によって記載されている方法で、市販されているL-グルタミン酸メチルから調製することができる。

20

【0233】

中間体18(4R)-4-アミノ-4,5-ジヒドロフラン-2-カルボン酸メチルの調製

(4R)-4-アミノ-4,5-ジヒドロフラン-2-カルボン酸メチルは、Joseph P. Burkhardt, Gene W. Holbert, Brian W. Metcalf (Tetrahedron Lett., 25(46), 1984, pp. 5267-5270)によって記載されている方法で、市販されているD-グルタミン酸メチルから調製することができる。

【0234】

実施例I-01シス-4-[[3-(3,5-ジフルオロフェニル)-5-メチル-4H-イソオキサゾール-5-カルボニル]アミノ]テトラヒドロフラン-2-カルボン酸メチルの調製

292 mg (2.88 mmol)のトリエチルアミンを5 mLのジクロロメタンの中の262 mg (1.44 mmol)の中間体14に添加し、次いで、6 mLのジクロロメタンの中の250 mg (0.96 mmol)のカルボニルクロリド(中間体4)を0で添加し、その混合物を6時間攪拌して室温まで昇温させ、最後に水を添加した。その有機相を除去し、硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下で濃縮した。その蒸発残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(移動相 n-ヘプタン/酢酸エチル)に付して、75 mg (2.1%)のシス-4-[[3-(3,5-ジフルオロフェニル)-5-メチル-4H-イソオキサゾール-5-カルボニル]アミノ]テトラヒドロフラン-2-カルボン酸メチルが得られた。

30

40

【0235】

実施例I-02シス-4-[[3-(3,5-ジクロロフェニル)-5-メトキシ-4H-イソオキサゾール-5-カルボニル]アミノ]テトラヒドロフラン-2-カルボン酸メチルの調製

277 mg (2.74 mmol)のトリエチルアミンを5 mLのジクロロメタンの中の249 mg (1.37 mmol)の中間体14に添加し、次いで、5 mLのジクロロメタンの中の282 mg (0.91 mmol)の3-(3,5-ジクロロフェニル)-5-メトキシ-4H-イソオキサゾール-5-カルボニルクロリドを0で添加し、その混合物を6時間攪拌して室温まで昇温させ、最後に、水を添加した。その有機相を除去し、硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下で濃縮した。その蒸発残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(

50

移動相 n - ヘプタン / 酢酸エチル) に付して、41 mg (11%) のシス - 4 - [[3 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 5 - メトキシ - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルが得られた。

【0236】

実施例 I - 03

シス - 4 - [[3 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルの調製

3, 5 - ジクロロベンズアルデヒドで出発して、最初に、中間体 9 の調製と同様にして、対応するカルボニルクロリドを調製した。これを、次いで、実施例 I - 02 と同様にして、目標化合物に変換させた。

【0237】

このようにして、317 mg (1.74 mmol) の中間体 14 及び 400 mg (1.39 mmol) のカルボニルクロリドから、10 mg (2%) のシス - 4 - [[3 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルが得られた。

【0238】

実施例 I - 04

シス - 4 - [[3 - (3 - ブロモ - 5 - メチルフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルの調製

3 - ブロモ - 5 - メチルベンズアルデヒドで出発して、最初に、中間体 4 の調製と同様にして、対応するカルボニルクロリドを調製した。これを、次いで、実施例 I - 02 と同様にして、目標化合物に変換させた。

【0239】

このようにして、129 mg (0.71 mmol) の中間体 14 と 150 mg (0.47 mmol) のカルボニルクロリドから、22 mg (11%) のシス - 4 - [[3 - (3 - ブロモ - 5 - メチルフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルが得られた。

【0240】

実施例 I - 05

シス - 4 - [[3 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メトキシ - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルの調製

3, 5 - ジフルオロベンズアルデヒドで出発して、中間体 4 の調製と同様にして、最初に、対応するカルボニルクロリドを調製した。これを、次いで、実施例 I - 02 と同様にして、目標化合物に変換させた。

【0241】

このようにして、247 mg (1.36 mmol) の中間体 14 と 250 mg (0.90 mmol) のカルボニルクロリドから、63 mg (18%) のシス - 4 - [[3 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メトキシ - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルが得られた。

【0242】

実施例 I - 06

シス - 4 - [[3 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルの調製

中間体 4 の調製と同様にして、最初に、対応するカルボニルクロリドを調製し、次いで、それを、実施例 I - 02 と同様にして、目標化合物に変換させた。

【0243】

このようにして、184 mg (1.01 mmol) の中間体 14 及び 212 mg (0.67 mmol) のカルボニルクロリドから、39 mg (13%) のシス - 4 - [[3 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 H - イソオキサゾール -

10

20

30

40

50

5 - カルボニル]アミノ]テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルが得られた。

【0244】

実施例 I - 07

シス - 4 - [[3 - (3 - フルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルの調製

中間体 9 の調製と同様にして、最初に、対応するカルボニルクロリドを調製し、それを、実施例 I - 02 と同様にして、目標化合物に変換させた。

【0245】

このようにして、184 mg (1.01 mmol) の中間体 14 及び 212 mg (0.67 mmol) のカルボニルクロリドから、64 mg (26%) のシス - 4 - [[3 - (3 - フルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルが得られた。

10

【0246】

実施例 I - 08

シス - 4 - [[3 - (3 - ブロモ - 5 - メチルフェニル) - 5 - メトキシ - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルの調製

中間体 4 の調製と同様にして、最初に、対応するカルボニルクロリドを調製し、それを、実施例 I - 02 と同様にして、目標化合物に変換させた。

【0247】

このようにして、184 mg (1.01 mmol) の中間体 14 及び 212 mg (0.67 mmol) のカルボニルクロリドから、64 mg (26%) のシス - 4 - [[3 - (3 - フルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルが得られた。

20

【0248】

実施例 I - 09

シス - 4 - [[(5 R) - 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルの調製

中間体 4 の調製と同様にして、最初に、対応するカルボニルクロリドを調製し、それを、実施例 I - 01 と同様にして、目標化合物に変換させた。

30

【0249】

このようにして、227 mg (1.24 mmol) の中間体 14 及び 216 mg (0.83 mmol) のカルボニルクロリドから、79 mg (25%) のシス - 4 - [[(5 R) - 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルが得られた。

【0250】

個々のジアステレオマーのその混合物は、HPLCによって、I - 15 及び I - 16 に分離させた。

【0251】

実施例 I - 10

シス - 4 - [[(5 S) - 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルの調製

中間体 9 の調製と同様にして、最初に、対応するカルボニルクロリドを調製し、それを、実施例 I - 01 と同様にして、目標化合物に変換させた。

40

【0252】

このようにして、246 mg (1.35 mmol) の中間体 14 及び 228 mg (0.90 mmol) のカルボニルクロリドから、110 mg (31%) のシス - 4 - [[(5 S) - 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルが得られた。

50

【 0 2 5 3 】

個々のジアステレオマーのその混合物は、HPLCによって、I - 1 1 及び I - 1 2 に分離させた。

【 0 2 5 4 】

実施例 I - 1 1 : I - 1 0 のジアステレオマー 1

シス - 4 - [[(5 S) - 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルの調製

H - NMR データ : 分析データに関する下記表を参照されたい。

【 0 2 5 5 】

実施例 I - 1 2 : I - 1 0 のジアステレオマー 2

シス - 4 - [[(5 S) - 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルの調製

H - NMR データ : 分析データに関する下記表を参照されたい。

【 0 2 5 6 】

実施例 I - 1 3

シス - 4 - [[3 - (3 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルの調製

中間体 4 の調製と同様にして、最初に、対応するカルボニルクロリドを調製し、それを、実施例 I - 0 1 と同様にして、目標化合物に変換させた。

【 0 2 5 7 】

このようにして、169 mg (0 . 9 3 mmol) の中間体 1 4 及び 1 5 0 mg (0 . 6 2 mmol) のカルボニルクロリドから、171 mg (7 5 %) のシス - 4 - [[3 - (3 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルが得られた。

【 0 2 5 8 】

実施例 I - 1 4

シス - 4 - [(5 - メトキシ - 3 - フェニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル) アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルの調製

中間体 1 0 の調製と同様にして、最初に、対応するカルボニルクロリドを調製し、それを、実施例 I - 0 3 と同様にして、目標化合物に変換させた。

【 0 2 5 9 】

このようにして、247 mg (1 . 3 5 mmol) の中間体 1 4 及び 2 1 7 mg (0 . 9 0 mmol) のカルボニルクロリドから、75 mg (2 3 %) のシス - 4 - [(5 - メトキシ - 3 - フェニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル) アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルが得られた。

【 0 2 6 0 】

実施例 I - 1 5 : I - 0 9 のジアステレオマー 1

シス - 4 - [[(5 R) - 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルの調製

H - NMR データ : 分析データに関する下記表を参照されたい。

【 0 2 6 1 】

実施例 I - 1 6 : I - 0 9 のジアステレオマー 2

シス - 4 - [[(5 R) - 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチル

H - NMR データ : 分析データに関する下記表を参照されたい。

【 0 2 6 2 】

実施例 I - 1 7

10

20

30

40

50

3 - [[3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルの調製

最初に、対応するカルボニルクロリドを調製し、それを、実施例 I - 0 1 と同様に反応させて、目標化合物が得られた。

【 0 2 6 3 】

このようにして、1.57 g (8.66 mmol) の 3 - アミノテトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチル塩酸塩及び 1.50 g (5.77 mmol) のカルボニルクロリドから、477 mg (22%) の 3 - [[3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルが得られた。

10

【 0 2 6 4 】

実施例 I - 1 8

3 - [[3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸エチルの調製

標題化合物は、実施例 I - 1 7 と同様にして、調製することができる。

【 0 2 6 5 】

実施例 I - 1 9

4 - [[3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルの調製

最初に、対応するカルボニルクロリドを調製し、それを、実施例 I - 0 1 と同様に 4 - アミノテトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルと反応させて、目標化合物が得られた。

20

【 0 2 6 6 】

このようにして、419 mg (8.66 mmol) の 4 - アミノテトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチル及び 500 mg (1.92 mmol) のカルボニルクロリドから、657 mg (91%) の 4 - [[3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルが得られた。

【 0 2 6 7 】

実施例 I - 2 0

シス - 4 - [[3 - (3 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸の調製

1 mL の 2 N 塩酸を 85 mg (0.24 mmol) のシス - 4 - [[3 - (3 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルに添加し、その混合物を室温で 3 日間維持した。次いで、その反応混合物を、ロータリーエバポレーターで濃縮した。このようにして、33 mg (40%) のシス - 4 - [[3 - (3 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸が得られた。

30

【 0 2 6 8 】

実施例 I - 2 1

シス - 4 - [[3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸の調製

650 mg (1.70 mmol) のシス - 4 - [[3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルを 10 mL のテトラヒドロフランに添加し、0.64 mL の 2 N 水酸化ナトリウム水溶液を室温で添加し、その混合物を 6 時間攪拌した。次いで、その混合物を濃塩酸を用いて酸性化し、酢酸エチルで抽出し、そして、その有機相を硫酸ナトリウムで脱水した。その有機相を蒸発させて、530 mg (83%) のシス - 4 - [[3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸が得られた。

40

50

【0269】

実施例 I - 2 2

シス - 4 - [[(5 R) - 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルの調製

標題化合物は、実施例 I - 0 1 と同様にして、268 mg (0 . 9 8 m m o l) の対応するカルボニルクロリド及び215 mg (1 . 4 8 m m o l) のアミン (中間体 1 4) から調製した。

【0270】

このようにして、64 mg (1 7 %) のシス - 4 - [[(5 R) - 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルが得られた。

10

【0271】

実施例 I - 2 3

4 - [[3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] - 2 , 5 - ジヒドロフラン - 3 - カルボン酸エチルの調製

最初に、「F. Cohen et al., J. Med. Chem. 2011, 54, 3426-3435」と同様にして、4 - アミノ - 2 , 5 - ジヒドロフラン - 3 - カルボン酸エチルを4 - オキシテトラヒドロフランカルボン酸エチルから調製し、次いで、それを、I - 0 1 の手順と同様にして、対応するカルボニルクロリド (中間体 9) と反応させた。

20

【0272】

このようにして、230 mg (0 . 8 4 m m o l) のカルボニルクロリド及び166 mg (1 . 0 5 m m o l) のアミンから52 mg (1 5 %) の4 - [[3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] - 2 , 5 - ジヒドロフラン - 3 - カルボン酸エチルが得られた。

【0273】

実施例 I - 2 4

4 - [[3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] - 2 , 5 - ジヒドロフラン - 3 - カルボン酸エチルの調製

最初に、「F. Cohen et al., J. Med. Chem. 2011, 54, 3426-3435」と同様にして、4 - アミノ - 2 , 5 - ジヒドロフラン - 3 - カルボン酸エチルを4 - オキシテトラヒドロフランカルボン酸エチルから調製し、それを、次いで、I - 0 1 の手順と同様にして、対応するカルボニルクロリド (中間体 4) と反応させた。

30

【0274】

このようにして、220 mg (0 . 8 4 m m o l) のカルボニルクロリド及び166 mg (1 . 0 5 m m o l) のアミンから175 mg (5 3 %) の4 - [[3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] - 2 , 5 - ジヒドロフラン - 3 - カルボン酸エチルが得られた。

40

【0275】

実施例 I - 2 5

4 - [[3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] - 2 , 5 - ジヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルの調製

最初に、「F. Cohen et al., J. Med. Chem. 2011, 54, 3426-3435」と同様にして、4 - アミノ - 2 , 5 - ジヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルを4 - オキシテトラヒドロフランカルボン酸メチルから調製し、それを、次いで、I - 0 1 の手順と同様にして、対応するカルボニルクロリド (中間体 4) と反応させた。

【0276】

50

このようにして、200 mg (0.77 mmol) のカルボニルクロリド及び165 mg (1.15 mmol) のアミンから、94 mg (33%) の4 - [[3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] - 2 , 5 - ジヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルが得られた。

【0277】

実施例 I - 26

4 - [[(5 S) - 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルの調製
最初に、対応するカルボニルクロリドを調製し、それを、実施例 I - 01 と同様に4 - アミノテトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルと反応させて、目標化合物が得られた。

10

【0278】

このようにして、110 mg (0.40 mmol) のカルボニルクロリド及び88 mg (0.60 mmol) のシス - 4 - アミノテトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルから、7 mg (4%) の4 - [[(5 S) - 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルが得られた。

【0279】

実施例 I - 27

4 - [[3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メトキシ - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルの調製
最初に、対応するカルボニルクロリドを調製し、それを、実施例 I - 02 と同様にして、4 - アミノテトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルと反応させて、目標化合物が得られた。

20

【0280】

このようにして、112 mg (0.40 mmol) のカルボニルクロリド及び88 mg (0.60 mmol) の4 - アミノテトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルから、28 mg (17%) の4 - [[3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メトキシ - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルが得られた。

【0281】

30

実施例 I - 28

4 - [[(5 R) - 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルの調製
中間体4の調製と同様にして、最初に、対応するカルボニルクロリドを調製し、それを、実施例 I - 01 に準じて、4 - アミノテトラフラン - 3 - カルボン酸メチルを用いて目標化合物に変換させた。

【0282】

このようにして、110 mg (0.42 mmol) のカルボニルクロリド及び92 mg (0.63 mmol) の4 - アミノテトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルから、36 mg (23%) の4 - [[(5 R) - 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルが得られた。

40

【0283】

実施例 I - 29

4 - [[3 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 5 - メトキシ - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルの調製
最初に、対応するカルボニルクロリド (中間体 10) を調製し、それを、実施例 I - 02 と同様にして、4 - アミノテトラヒドロフラン - 3 - カルボン酸メチルと反応させて、目標化合物が得られた。

【0284】

50

このようにして、110 mg (0.35 mmol) のカルボニルクロリド及び78 mg (0.53 mmol) の4-アミノテトラヒドロフラン-3-カルボン酸メチルから、80 mg (53%) の4-[[3-(3,5-ジクロロフェニル)-5-メトキシ-4H-イソキサゾール-5-カルボニル]アミノ]テトラヒドロフラン-3-カルボン酸メチルが得られた。

【0285】

実施例 I - 30

シス-4-[[(5RS) - 3 - (3-フルオロフェニル) - 5 - メチル - 4H - イソキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸エチルの調製
0.10 g のカルボン酸、85 mg の1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩及び4 mg の4-ジメチルアミノピリジンを5 mL のジクロロメタンに溶解させた。

10

【0286】

次いで、室温で攪拌しながら、68 mg のエタノールを添加し、その反応混合物を室温で8時間攪拌し、次いで、一晩攪拌した。

【0287】

その反応混合物を0.5 M 水性塩酸で洗浄し、脱水し、減圧下で濃縮した。次いで、その粗製生成物をクロマトグラフィーで精製した。

【0288】

これによって、55 mg のエチルエステル (収率49%) が得られた。

20

【0289】

実施例 I - 31

シス-4-[[(5S) - 3 - (3,5-ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4H - イソキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸の調製
0.52 g の該メチルエステルを8 mL のテトラヒドロフランに溶解させ、0 まで冷却した。攪拌しながら、98 mg の水酸化リチウムを4 mL の水に溶解させた溶液を滴下して加えた。攪拌しながら、その反応混合物を1時間かけて室温とした。次いで、その反応混合物を水で稀釈し、0.5 M 水性塩酸を用いて酸性化し、酢酸エチルで抽出した。得られた酢酸エチル相を、次いで、脱水し、減圧下で濃縮した。

【0290】

さらに精製するために、次いで、その粗製生成物を取って2 M 水酸化ナトリウム水溶液の中に入れ、酢酸エチルで洗浄した。次いで、その水相を2 M 水性塩酸を用いて酸性化し、ジクロロメタンで抽出した。そのジクロロメタン相を脱水し、濃縮した。これによって、0.53 g のカルボン酸 (収率84%) が得られた。

30

【0291】

実施例 I - 32

シス-4-[[(5RS) - 3 - (3-フルオロフェニル) - 5 - メチル - 4H - イソキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸イソプロピルの調製

0.12 g のカルボン酸、98 mg の1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩及び4 mg の4-ジメチルアミノピリジンを5 mL のジクロロメタンに溶解させた。

40

【0292】

室温で攪拌しながら、次いで、0.41 g の2-プロパノールを添加し、その反応混合物を室温で1.5時間攪拌し、次いで、3日間攪拌した。

【0293】

その反応混合物を0.5 M 水性塩酸で洗浄し、脱水し、減圧下で濃縮した。次いで、その粗製生成物をクロマトグラフィーで精製した。

【0294】

これによって、82 mg の2-プロピルエステル (収率61%) が得られた。

50

【 0 2 9 5 】

実施例 I - 3 3

シス - 4 - [[(5 R S) - 3 - (3 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸 tert - ブチルの調製

0 . 1 1 g のカルボン酸を 2 m L のテトラヒドロフランに溶解させ、そして、窒素下に置いた。

【 0 2 9 6 】

シリンジフィルターを介して、0 . 2 m L の N , N ' - ジイソプロピルカルバムイミド酸 tert - ブチルを添加した。その反応混合物を 3 時間加熱環流し、そして、冷却し、追加の 0 . 2 m L の N , N ' - ジイソプロピルカルバムイミド酸 tert - ブチルを添加した。その反応混合物をさらに 2 時間加熱環流し、次いで、室温まで冷却した。

10

【 0 2 9 7 】

次いで、その反応混合物を酢酸エチルで希釈し、セライトで濾過し、追加の酢酸エチルで濯ぎ洗った。その濾液を合して減圧下で濃縮し、カラムクロマトグラフィーで精製した。HPLC によるさらなる精製に付して、6 1 m g の tert - ブチルエステル (収率 4 8 %) が得られた。

【 0 2 9 8 】

実施例 I - 3 4

シス - 4 - [[(5 R S) - 3 - (3 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸ベンジルの調製

20

0 . 1 0 g のカルボン酸、8 9 m g の 1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩及び 4 m g の 4 - ジメチルアミノピリジンを 5 m L のジクロロメタンに溶解させた。

【 0 2 9 9 】

室温で攪拌しながら、次いで、0 . 6 7 g のベンジルアルコールを添加し、その反応混合物を室温で 1 . 5 時間攪拌し、次いで、3 日間攪拌した。

【 0 3 0 0 】

その反応混合物を 0 . 5 M 水性塩酸で洗浄し、脱水し、減圧下で濃縮した。次いで、その粗製生成物をクロマトグラフィーで精製した。

30

【 0 3 0 1 】

これによって、8 4 m g (6 1 %) のベンジルエステルが得られた。

【 0 3 0 2 】

実施例 I - 3 5

シス - 4 - [[(5 S) - 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸エチルの調製

0 . 1 2 g のカルボン酸及び 8 m g の 4 - ジメチルアミノピリジンを 5 m L のジクロロメタンに溶解させた。室温で攪拌しながら、9 2 m g の 1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩を添加し、その後、0 . 2 2 g のエタノールを添加し、その反応混合物を室温で 1 . 5 時間攪拌し、次いで、この温度で 3 6 時間攪拌した。

40

【 0 3 0 3 】

その反応混合物を 0 . 5 M 水性塩酸で洗浄し、脱水し、減圧下で濃縮した。次いで、その粗製生成物をクロマトグラフィーで精製した。

【 0 3 0 4 】

これによって、8 2 m g のエチルエステル (収率 6 4 %) が得られた。

【 0 3 0 5 】

実施例 I - 3 6

シス - 4 - [[(5 S) - 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イ

50

ソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸イソプロピルの調製

0.13 g のカルボン酸及び 9 mg の 4 - ジメチルアミノピリジンを 5 mL のジクロロメタンに溶解させた。室温で攪拌しながら、104 mg の 1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩を添加し、その後、0.33 g の 2 - プロパノールを添加し、その反応混合物を室温で 1.5 時間攪拌し、次いで、この温度で 36 時間攪拌した。

【 0 3 0 6 】

その反応混合物を 0.5 M 水性塩酸で洗浄し、脱水し、減圧下で濃縮した。次いで、その粗製生成物をクロマトグラフィーで精製した。

【 0 3 0 7 】

これによって、106 mg の 2 - プロピルエステル (収率 71%) が得られた。

【 0 3 0 8 】

実施例 I - 37

シス - 4 - [[(5 S) - 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸ベンジルの調製

0.10 g のカルボン酸及び 0.04 g のベンジルアルコールを 5 mL のジクロロメタンに溶解させた。室温で攪拌しながら、0.07 g の N , N - ジイソプロピルエチルアミンを添加し、その後、この混合物に、テトラヒドロフランの中のプロピルホスホン酸無水物の溶液 (50% 強度) 0.26 g を添加し、次いで、その反応混合物を室温で 1 時間攪拌した。

【 0 3 0 9 】

その反応混合物を飽和重炭酸ナトリウム水溶液で洗浄し、脱水し、減圧下で濃縮した。

【 0 3 1 0 】

これによって、100 mg のベンジルエステル (収率 73%) が得られた。

【 0 3 1 1 】

実施例 I - 38

シス - 4 - [[(5 S) - 3 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 5 - ビニル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸 tert - ブチルの調製

0.13 g のカルボン酸を 2 mL のテトラヒドロフランに溶解させ、窒素下に置いた。

【 0 3 1 2 】

シリンジフィルターを介して、0.2 mL の N , N' - ジイソプロピルカルバムイミド酸 tert - ブチルを添加した。その反応混合物を 3 時間加熱環流し、そして、冷却し、追加の 0.2 mL の N , N' - ジイソプロピルカルバムイミド酸 tert - ブチルを添加した。その反応混合物をさらに 2 時間加熱環流し、次いで、室温まで冷却した。

【 0 3 1 3 】

次いで、その反応混合物を酢酸エチルで希釈し、セライトで濾過し、追加の酢酸エチルで濯ぎ洗った。その濾液を合して減圧下で濃縮し、カラムクロマトグラフィーで精製した。HPLC によるさらなる精製に付して、84 mg の tert - ブチルエステル (収率 54%) が得られた。

【 0 3 1 4 】

実施例 I - 39 及び実施例 I - 40

(3 S) - 3 - [[3 - (3 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] - 2 , 3 - ジヒドロフラン - 5 - カルボン酸メチル及び (2 S , 4 S) - 4 - [[3 - (3 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 H - イソオキサゾール - 5 - カルボニル] アミノ] - 2 - メトキシテトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸メチルの調製

0.43 g の中間体 17 (塩酸塩として) 及び 0.42 g のカルボン酸を 15 mL のジク

10

20

30

40

50

クロロメタンに溶解させた。室温で攪拌しながら、0.78 mLのトリエチルアミンを添加し、その後、この混合物に、テトラヒドロフランの中のプロピルホスホン酸無水物の溶液(50%強度)3.34 mLを添加し、次いで、その反応混合物を室温で3時間攪拌した。その反応混合物を飽和重炭酸ナトリウム水溶液で洗浄し、脱水し、減圧下で濃縮した。次いで、その粗製生成物をクロマトグラフィーで精製した。

【0315】

これによって、40 mg(収率5%)の(3S)-3-[[3-(3-フルオロフェニル)-5-メチル-4H-イソキサゾール-5-カルボニル]アミノ]-2,3-ジヒドロフラン-5-カルボン酸メチル及び96 mg(収率13%)の(2S,4S)-4-[[3-(3-フルオロフェニル)-5-メチル-4H-イソキサゾール-5-カルボニル]アミノ]-2-メトキシテトラヒドロフラン-2-カルボン酸メチルが得られた。

10

【0316】

実施例I-46及び実施例I-47

(3R)-3-[[3-(3-フルオロフェニル)-5-メチル-4H-イソキサゾール-5-カルボニル]アミノ]-2,3-ジヒドロフラン-5-カルボン酸メチル及び(2R,4R)-4-[[3-(3-フルオロフェニル)-5-メチル-4H-イソキサゾール-5-カルボニル]アミノ]-2-メトキシテトラヒドロフラン-2-カルボン酸メチルの調製

該調製は、実施例I-39及び実施例I-40において示されている条件下で、中間体18(塩酸塩として)と同様にして実施した。

20

【0317】

実施例I-55

トランス-4-[[(5R)-3-(3,5-ジフルオロフェニル)-5-メチル-4H-イソキサゾール-5-カルボニル]アミノ]テトラヒドロフラン-2-カルボン酸メチルの調製

0.08 gの中間体16及び0.11 mgのカルボン酸を5 mLのジクロロメタンに溶解させた。室温で攪拌しながら、0.18 mLのトリエチルアミンを添加し、その後、この混合物に、テトラヒドロフランの中のプロピルホスホン酸無水物の溶液(50%強度)0.79 mLを添加し、次いで、その反応混合物を室温で2時間攪拌した。その反応混合物を飽和重炭酸ナトリウム水溶液で洗浄し、脱水し、減圧下で濃縮した。次いで、その粗製生成物をクロマトグラフィーで精製した。これによって、90 mg(収率54%)が得られた。

30

【0318】

実施例I-56

トランス-4-[[(5S)-3-(3,5-ジフルオロフェニル)-5-ビニル-4H-イソキサゾール-5-カルボニル]アミノ]テトラヒドロフラン-2-カルボン酸メチルの調製

該調製は、0.08 gの中間体16及び0.11 gのカルボン酸を使用して、実施例I-55と同様にして実施した。これによって、110 mg(収率64%)が得られた。

【0319】

40

【表 2】

実施例 I-01 - 実施例 I-56 の分析データ

No.	NMR
I-01	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.518(1.0);7.260(181.8);7.171(1.8);7.166(2.2);7.162(1.3);7.155(1.2);7.151(2.2);7.146(1.8);6.996(1.0);6.898(0.6);6.883(0.7);6.882(0.7);6.878(1.2);6.876(1.2);6.870(0.6);6.854(0.6);4.578(1.1);4.573(0.7);4.569(1.1);4.560(0.5);4.554(1.6);4.545(1.3);4.530(1.0);4.521(0.8);4.065(0.8);4.052(0.8);4.042(1.3);4.029(1.7);4.017(0.8);4.006(1.1);3.993(1.0);3.967(0.7);3.962(0.7);3.900(0.6);3.896(0.6);3.834(14.5);3.785(16.0);3.773(2.0);3.756(1.8);3.730(2.2);3.712(2.0);3.190(1.9);3.182(2.0);3.146(1.6);3.138(1.8);2.558(0.7);2.541(0.9);2.524(0.8);2.506(0.5);2.019(0.5);1.710(11.3);1.687(10.3);1.541(35.4);0.008(2.1);0.000(68.8);-0.008(1.9)
I-02	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.556(5.0);7.552(6.9);7.552(6.5);7.548(6.3);7.518(1.0);7.438(1.8);7.437(1.6);7.433(3.1);7.432(2.8);7.429(1.5);7.427(1.4);7.268(0.6);7.267(0.7);7.260(105.5);6.996(0.6);5.298(5.7);4.677(0.6);4.671(0.6);4.590(0.8);4.582(1.2);4.574(0.7);4.567(0.8);4.558(1.3);4.551(0.7);4.061(0.6);4.048(0.7);4.045(1.3);4.037(1.4);4.033(1.2);4.024(1.3);4.014(0.6);4.010(0.7);4.000(0.7);3.994(0.8);3.890(1.5);3.848(1.9);3.844(1.9);3.810(15.9);3.802(2.2);3.792(13.4);3.359(13.3);3.355(16.0);3.337(2.2);3.320(1.8);3.291(1.8);3.274(1.6);2.591(0.5);2.573(0.6);2.567(0.5);2.126(0.5);1.538(20.2);0.008(1.3);0.000(42.8);-0.008(1.2)
I-03	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.595(2.6);7.590(2.9);7.526(7.9);7.521(8.3);7.518(2.3);7.448(1.1);7.445(1.4);7.443(1.4);7.419(2.0);7.414(3.2);7.409(1.7);7.259(347.5);6.995(1.9);6.172(1.3);6.145(1.6);6.129(1.6);6.102(1.7);5.556(1.6);5.555(1.8);5.540(1.0);5.513(1.5);5.512(1.5);5.497(0.8);5.355(1.6);5.341(0.8);5.328(1.4);5.314(0.8);5.298(3.5);4.594(0.6);4.587(0.7);4.572(0.8);4.564(0.9);4.556(1.0);4.548(1.0);4.541(0.5);4.533(0.8);4.524(0.8);4.053(1.3);4.040(1.6);4.029(1.4);4.016(1.7);4.008(0.6);4.003(0.8);3.949(0.8);3.924(2.5);3.903(1.3);3.881(2.1);3.860(1.4);3.857(5.2);3.827(5.8);3.814(9.6);3.803(16.0);3.326(1.0);3.318(1.1);3.315(1.0);3.308(1.8);3.301(1.0);3.290(1.0);3.274(0.8);3.265(1.5);2.837(0.7);2.835(0.7);2.526(0.6);2.508(0.5);2.039(0.6);2.004(0.8);1.532(84.5);1.284(0.5);1.256(0.5);0.899(2.5);0.896(2.3);0.884(2.5);0.880(2.3);0.008(4.3);0.000(146.4);-0.008(3.9)
I-04	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.018(1.1);7.569(1.2);7.518(6.4);7.384(2.3);7.359(2.0);7.322(2.1);7.308(2.4);7.295(2.9);7.259(1071.8);7.252(5.2);7.251(1.9);7.250(1.7);7.249(1.6);7.248(1.4);7.248(1.5);7.247(1.5);7.246(1.5);7.245(1.3);7.244(1.2);7.244(1.2);7.242(1.1);7.241(1.2);7.240(1.2);7.239(1.1);7.236(1.4);7.232(1.6);7.227(1.8);7.221(1.6);7.217(1.8);7.209(2.1);7.194(1.1);7.150(0.6);6.995(5.9);5.298(16.0);4.565(0.8);4.541(0.8);4.419(0.6);4.392(0.6);4.113(0.6);4.043(0.8);3.991(0.9);3.947(0.9);3.825(3.9);3.786(4.3);3.772(4.7);3.760(4.6);3.746(1.4);3.706(1.6);3.633(1.5);3.589(0.6);3.424(2.1);3.203(2.3);3.166(0.9);3.142(0.9);3.129(1.8);3.124(2.2);3.040(2.4);2.992(2.0);2.986(1.8);2.955(11.0);2.884(9.4);2.882(9.4);2.553(0.6);2.352(6.6);2.340(2.6);2.321(1.4);2.221(3.9);2.043(2.2);2.003(1.2);1.714(6.2);1.704(6.4);1.686(6.9);1.676(5.7);1.664(6.0);1.658(6.2);1.495(2.1);1.434(2.5);1.333(1.0);1.284(1.1);1.258(1.9);0.146(1.4);0.008(13.6);0.000(458.9);-0.008(12.8);-0.051(0.7);-0.149(1.4)
I-05	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.518(1.6);7.310(0.5);7.259(217.2);7.227(0.5);7.211(1.3);7.208(1.9);7.205(2.0);7.202(2.0);7.191(2.0);7.188(1.8);7.186(1.9);7.182(1.2);6.995(1.2);6.920(0.7);6.904(0.8);6.898(1.3);6.894(0.7);6.878(0.7);4.678(0.6);4.673(0.6);4.667(0.5);4.591(0.7);4.583(1.3);4.575(0.9);4.568(0.8);4.560(1.4);4.552(0.8);4.071(0.5);4.059(0.7);4.047(1.6);4.037(1.6);4.035(1.6);4.025(1.3);4.015(0.8);4.012(0.8);4.002(0.7);3.998(0.7);3.884(1.8);3.841(1.9);3.838(2.3);3.810(14.7);3.796(2.4);3.790(16.0);3.366(15.8);3.362(15.0);3.343(2.1);3.326(2.2);3.298(1.8);3.280(1.8);2.593(0.5);2.580(0.5);2.573(0.6);2.562(0.6);2.556(0.5);2.552(0.5);2.545(0.5);2.146(0.5);2.128(0.5);2.119(0.5);1.539(11.2);0.008(2.6);0.000(88.3);-0.008(2.4)
I-06	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.261(34.4);7.205(1.5);7.200(2.0);7.196(1.2);7.189(1.2);7.185(1.9);7.180(1.6);6.960(0.8);6.945(0.8);6.939(1.5);6.933(0.7);6.917(0.7);5.298(5.5);4.678(0.5);4.675(0.6);4.663(0.6);4.658(0.5);4.606(0.6);4.598(0.7);4.585(0.8);4.582(0.8);4.577(1.0);4.575(0.8);4.561(0.8);4.554(0.8);4.074(0.7);4.061(0.7);4.050(1.4);4.047(0.6);4.037(1.3);4.035(0.6);4.022(1.2)

10

20

30

40

50

);4.010(1.2);4.000(0.7);3.998(0.8);3.993(1.2);3.987(0.8);3.985(0.7);3.980(0.9);3.969(0.6);3.955(0.6);3.934(1.1);3.910(0.9);3.829(12.4);3.798(16.0);3.752(2.0);3.746(2.3);3.707(1.3);3.701(1.6);2.521(0.5);2.104(0.6);2.099(0.6);2.096(0.6);1.556(6.0);0.000(14.2)	
I-07	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ=7.405(0.7);7.404(0.8);7.402(1.0);7.400(1.0);7.398(1.0);7.394(1.4);7.393(1.4);7.388(0.9);7.385(1.5);7.380(5.0);7.377(2.9);7.375(2.0);7.372(2.8);7.368(1.5);7.261(32.6);7.149(0.6);7.143(0.6);7.135(0.8);7.133(0.7);7.127(0.8);7.114(0.5);6.189(1.3);6.163(1.4);6.146(1.5);6.119(1.6);5.562(1.7);5.561(1.7);5.547(1.4);5.545(1.4);5.519(1.5);5.518(1.5);5.504(1.2);5.502(1.2);5.346(1.4);5.345(1.4);5.334(1.2);5.332(1.2);5.320(1.4);5.318(1.4);5.307(1.1);5.305(1.1);5.298(2.9);4.572(0.9);4.564(0.8);4.554(0.9);4.549(0.9);4.545(0.9);4.540(0.7);4.531(0.8);4.521(0.8);4.062(0.8);4.049(0.8);4.044(0.7);4.039(1.2);4.031(0.7);4.026(1.2);4.020(1.0);4.007(0.9);3.952(0.7);3.950(0.7);3.946(2.5);3.926(2.6);3.921(1.0);3.919(0.9);3.903(2.6);3.883(1.9);3.815(13.3);3.796(16.0);3.357(1.6);3.348(1.9);3.314(1.4);3.305(1.6);2.542(0.6);2.531(0.6);2.513(0.5);2.042(0.5);1.572(4.6);0.000(12.8)	10
I-08	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ=7.613(0.7);7.611(0.8);7.607(1.5);7.605(1.4);7.603(1.4);7.598(0.7);7.596(0.6);7.413(2.8);7.411(3.9);7.409(4.0);7.407(3.5);7.262(34.4);5.298(11.2);4.675(0.6);4.670(0.5);4.667(0.5);4.654(0.5);4.589(0.7);4.580(1.5);4.572(0.8);4.565(0.8);4.557(1.5);4.548(0.8);4.074(0.6);4.063(0.7);4.062(0.7);4.050(1.8);4.039(1.6);4.038(1.6);4.027(1.2);4.014(0.7);4.012(0.7);4.009(0.8);4.006(0.7);3.998(0.6);3.996(0.7);3.992(1.0);3.989(0.9);3.881(1.7);3.841(1.7);3.836(2.1);3.810(14.9);3.795(2.1);3.789(16.0);3.360(2.5);3.355(15.3);3.351(14.7);3.343(2.2);3.315(1.7);3.297(1.8);2.594(0.5);2.576(0.5);2.574(0.5);2.562(0.6);2.363(11.5);2.362(11.5);2.143(0.5);2.136(0.6);2.130(0.5);1.568(4.3);0.000(14.6)	
I-09	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ=7.263(29.0);7.172(1.9);7.166(2.3);7.163(1.3);7.155(1.3);7.152(2.2);7.146(1.9);6.900(0.6);6.898(0.6);6.884(0.7);6.882(0.7);6.878(1.3);6.876(1.2);6.872(0.7);6.870(0.6);6.856(0.6);6.854(0.6);5.299(4.4);4.579(1.2);4.574(0.7);4.569(1.2);4.560(0.6);4.554(1.7);4.545(1.4);4.530(0.9);4.521(0.8);4.066(0.7);4.053(0.7);4.042(1.2);4.029(1.7);4.017(0.8);4.006(1.2);3.993(1.1);3.967(0.7);3.963(0.6);3.961(0.6);3.902(0.6);3.900(0.6);3.896(0.6);3.894(0.6);3.834(16.0);3.785(15.8);3.779(0.7);3.774(2.3);3.757(1.9);3.730(2.2);3.714(2.2);3.191(2.0);3.183(1.9);3.148(1.7);3.140(1.7);2.565(0.6);2.559(0.7);2.541(0.9);2.524(0.8);2.122(0.5);2.020(0.5);1.710(10.7);1.687(10.9);1.585(5.6);0.000(11.5)	20
I-10	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ=7.262(28.6);7.180(2.2);7.174(2.6);7.171(1.5);7.163(1.5);7.160(2.6);7.154(2.1);6.903(0.8);6.887(0.9);6.882(1.6);6.876(0.8);6.860(0.8);6.176(2.0);6.150(2.3);6.133(2.4);6.106(2.5);5.560(1.8);5.558(1.8);5.544(1.7);5.543(1.7);5.517(1.5);5.515(1.5);5.501(1.5);5.500(1.4);5.357(1.6);5.356(1.6);5.343(1.5);5.342(1.5);5.330(1.5);5.329(1.5);5.316(1.4);5.315(1.4);5.299(9.2);4.603(0.5);4.596(0.6);4.591(0.6);4.585(0.6);4.579(0.6);4.574(1.1);4.565(1.2);4.558(1.1);4.550(1.4);4.542(0.9);4.534(0.9);4.525(0.8);4.056(0.8);4.043(0.9);4.041(0.9);4.033(1.3);4.028(0.8);4.020(1.3);4.017(1.4);4.004(1.1);3.950(0.7);3.946(0.7);3.944(0.7);3.929(1.1);3.922(2.7);3.905(0.5);3.899(2.3);3.878(2.2);3.856(2.2);3.814(15.9);3.800(16.0);3.322(1.9);3.313(1.9);3.279(1.6);3.270(1.7);2.566(0.5);2.564(0.5);2.555(0.6);2.549(0.5);2.546(0.5);2.540(0.6);2.538(0.6);2.531(0.6);2.529(0.6);2.514(0.5);2.511(0.6);2.094(0.6);2.060(0.5);2.052(0.5);2.044(0.6);1.577(5.9);0.000(11.4)	30
I-11	¹ H-NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ=7.494(0.6);7.474(0.6);7.278(0.9);7.184(1.5);7.178(2.0);7.176(1.4);7.167(1.3);7.164(2.0);7.159(1.7);6.906(0.6);6.890(0.7);6.884(1.3);6.879(0.7);6.863(0.6);6.180(1.1);6.153(1.2);6.137(1.4);6.110(1.4);5.560(2.2);5.559(2.2);5.516(1.9);5.516(1.9);5.358(2.1);5.331(2.0);4.622(0.5);4.615(0.6);4.611(0.6);4.608(0.6);4.602(0.6);4.597(0.6);4.562(1.0);4.553(1.2);4.539(1.2);4.530(1.1);4.060(0.9);4.047(1.0);4.036(1.5);4.023(1.4);3.955(1.1);3.951(1.2);3.928(2.9);3.885(2.5);3.801(16.0);3.322(2.3);3.279(2.0);2.569(0.5);2.551(0.6);2.546(0.6);2.534(0.7);2.528(0.6);2.517(0.7);2.511(0.7);2.493(0.6);2.056(0.5);2.050(0.8);2.043(0.6);2.015(0.8);2.009(0.5);0.000(0.8)	
I-12	¹ H-NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ=7.461(0.7);7.442(0.7);7.278(0.9);7.184(1.6);7.178(2.0);7.164(2.1);7.159(1.6);6.907(0.6);6.891(0.8);6.885(1.3);6.880(0.7);6.864(0.7);6.179(1.1);6.152(1.3);6.136(1.4);6.109(1.4);5.543(2.3);5.500(2.0);5.344(2.2);5.317(2.1);4.593(0.6);4.587(0.7);4.579(1.6);4.570(1.8);	40

	4.563(0.6);4.555(1.5);4.546(1.2);4.043(1.0);4.030(1.0);4.019(1.6);4.006(1.4);3.935(1.2);3.930(1.2);3.905(3.0);3.862(2.6);3.814(16.0);3.331(2.4);3.288(2.1);2.596(0.5);2.579(0.6);2.573(0.6);2.562(0.7);2.555(0.6);2.544(0.7);2.538(0.7);2.521(0.6);2.107(0.6);2.101(0.9);2.095(0.6);2.073(0.5);2.067(0.8);2.060(0.5);1.257(0.5);0.000(0.8)	
I-13	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.518(1.2);7.394(1.4);7.389(2.4);7.374(5.0);7.365(4.2);7.358(0.6);7.310(0.7);7.268(1.5);7.265(3.0);7.259(207.2);7.253(1.0);7.252(0.8);7.251(0.6);7.145(0.8);7.140(0.6);7.130(1.0);7.121(0.9);7.113(0.6);7.110(0.6);6.995(1.2);4.577(1.2);4.567(1.1);4.557(0.6);4.553(1.2);4.550(1.2);4.544(1.0);4.540(1.1);4.526(0.9);4.517(0.8);4.072(0.8);4.059(0.8);4.048(1.3);4.035(1.6);4.021(0.8);4.010(1.1);3.997(0.9);3.966(0.7);3.961(0.8);3.896(0.6);3.890(0.6);3.835(14.3);3.800(2.0);3.785(2.1);3.778(16.0);3.762(0.6);3.757(2.3);3.742(2.1);3.223(1.9);3.215(2.1);3.180(1.7);3.172(1.9);2.561(0.8);2.549(0.5);2.543(0.9);2.526(0.9);2.520(0.5);2.509(0.5);2.503(0.5);2.018(0.6);1.983(0.5);1.725(0.6);1.714(1.4);1.708(11.3);1.697(0.7);1.686(10.3);1.666(0.6);1.606(2.7);0.008(2.2);0.000(86.6);-0.008(2.6)	10
I-14	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.684(1.6);7.680(2.9);7.677(2.1);7.670(1.0);7.666(1.6);7.665(1.5);7.663(1.6);7.660(2.4);7.656(1.9);7.520(0.6);7.454(0.6);7.452(0.7);7.451(0.8);7.450(0.8);7.442(1.4);7.440(1.6);7.437(5.2);7.432(2.3);7.427(1.0);7.422(1.3);7.418(2.4);7.404(0.8);7.261(43.3);5.298(3.7);4.680(0.5);4.672(0.5);4.590(0.7);4.581(1.3);4.571(0.8);4.567(0.8);4.557(1.3);4.548(0.8);4.081(0.6);4.068(1.0);4.057(1.4);4.055(0.8);4.044(2.0);4.031(1.2);4.018(0.7);4.016(0.7);4.012(0.7);4.009(0.7);3.999(0.6);3.997(0.7);3.992(1.0);3.904(1.9);3.866(1.8);3.858(2.2);3.821(2.2);3.813(14.8);3.783(15.8);3.438(2.2);3.420(2.3);3.393(1.9);3.375(2.5);3.370(16.0);3.364(15.0);2.600(0.8);2.583(0.7);2.577(0.8);2.566(0.6);2.560(0.7);2.146(0.8);2.143(0.6);2.140(0.6);2.137(0.7);2.111(0.7);2.108(0.5);2.105(0.5);2.102(0.6);1.563(9.6);0.008(0.5);-0.000(18.3);-0.008(0.5)	
I-15	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.518(1.2);7.259(207.4);7.210(0.6);7.170(1.4);7.165(1.8);7.150(1.7);7.145(1.4);6.995(1.2);6.898(0.6);6.882(0.7);6.876(1.2);6.870(0.6);6.854(0.6);4.581(0.6);4.554(1.2);4.545(1.0);4.530(1.2);4.521(1.0);4.066(0.9);4.052(0.9);4.042(1.5);4.029(1.4);3.968(1.0);3.962(1.1);3.945(0.7);3.786(16.0);3.773(2.3);3.729(2.5);3.182(2.4);3.138(2.1);2.559(0.5);2.540(0.5);2.536(0.6);2.524(0.7);2.518(0.6);2.506(0.7);2.501(0.6);2.483(0.5);2.019(0.8);1.985(0.6);1.710(13.0);1.530(23.7);0.008(2.5);0.000(73.7);-0.008(2.3)	20
I-16	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.519(0.5);7.426(0.5);7.260(91.8);7.172(1.4);7.166(1.8);7.152(1.7);7.146(1.4);6.900(0.6);6.884(0.7);6.878(1.2);6.872(0.6);6.856(0.6);4.580(1.3);4.570(1.5);4.556(1.6);4.547(1.3);4.030(1.0);4.017(1.0);4.006(1.4);3.993(1.3);3.901(1.0);3.895(0.9);3.878(0.7);3.871(0.7);3.834(16.0);3.756(2.2);3.713(2.5);3.190(2.4);3.147(2.0);2.599(0.5);2.581(0.6);2.575(0.5);2.564(0.6);2.558(0.6);2.547(0.6);2.541(0.6);2.524(0.6);2.122(0.8);2.087(0.6);1.688(12.8);1.536(5.7);0.008(1.4);0.000(33.1);-0.008(1.1)	
I-17	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.260(62.3);7.217(0.8);7.186(1.3);7.181(2.3);7.178(1.4);7.175(1.5);7.171(1.1);7.167(1.6);7.164(1.3);7.161(2.3);7.155(1.1);6.919(0.5);6.913(0.9);6.897(1.1);6.891(1.8);6.886(0.9);6.876(0.5);6.870(0.9);4.239(1.7);4.215(2.1);4.203(1.6);4.179(1.9);4.012(1.6);4.002(2.5);3.996(1.5);3.993(2.0);3.988(1.1);3.982(2.1);3.977(2.8);3.968(0.9);3.964(0.9);3.946(1.3);3.922(1.1);3.769(1.9);3.760(1.7);3.724(14.8);3.716(2.1);3.706(16.0);3.208(3.1);3.165(2.8);2.624(0.6);2.603(0.5);2.590(0.9);2.584(0.6);2.570(0.6);2.551(0.8);2.252(0.6);2.236(0.5);2.219(0.5);2.190(0.6);2.174(0.6);1.723(14.0);1.547(5.9);0.008(0.7);0.000(23.6);-0.008(0.7)	30
I-18	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.262(30.8);7.221(0.9);7.184(1.4);7.178(2.2);7.173(1.6);7.168(1.1);7.164(1.8);7.158(2.1);7.153(1.0);6.917(0.6);6.911(1.0);6.905(0.5);6.895(1.2);6.889(2.0);6.884(1.0);6.874(0.6);6.868(1.0);5.299(2.7);4.230(1.9);4.206(2.9);4.198(1.6);4.190(1.3);4.188(2.9);4.173(4.5);4.170(3.3);4.155(3.8);4.152(1.2);4.137(1.2);4.009(1.5);4.006(1.9);3.997(1.9);3.993(2.0);3.990(1.4);3.982(2.8);3.978(2.6);3.974(1.7);3.962(1.8);3.953(1.2);3.928(1.0);3.776(2.0);3.766(1.6);3.733(2.3);3.723(1.8);3.207(3.2);3.164(2.8);2.625(0.7);2.610(0.5);2.608(0.5);2.592(1.0);2.589(0.9);2.575(0.6);2.573(0.5);2.570(0.5);2.556(1.0);2.245(0.6);2.229(0.5)	40

10

20

30

40

50

);2.184(0.7);2.168(0.6);2.151(0.6);1.726(16.0);1.215(3.2);1.197(9.0);1.180(10.3);1.162(3.9);0.000(12.2)	
I-19	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.263(33.4);7.258(0.6);7.179(0.5);7.174(1.4);7.168(1.8);7.165(2.3);7.159(2.1);7.157(1.5);7.154(2.0);7.148(2.2);7.145(1.7);7.140(1.3);7.040(0.7);7.021(0.7);6.916(0.8);6.910(0.8);6.900(0.8);6.894(1.7);6.888(1.5);6.882(0.6);6.879(0.7);6.872(1.0);6.866(0.8);4.715(0.8);4.710(0.6);4.706(0.8);4.700(0.6);4.696(0.8);4.690(0.5);4.225(0.7);4.203(1.7);4.181(1.8);4.159(0.9);4.149(0.6);4.131(1.6);4.113(1.6);4.095(0.6);4.038(0.9);4.023(0.9);4.014(1.8);4.000(1.8);3.991(1.0);3.976(1.1);3.950(1.0);3.934(1.0);3.927(0.9);3.922(1.0);3.911(0.9);3.907(1.1);3.899(0.9);3.884(0.9);3.792(2.0);3.780(2.0);3.774(0.6);3.772(0.5);3.757(0.9);3.746(16.0);3.741(1.2);3.737(6.0);3.731(1.2);3.725(1.0);3.710(0.6);3.704(0.6);3.691(1.6.0);3.680(1.1);3.665(0.9);3.656(0.8);3.541(3.0);3.211(2.8);3.188(0.6);3.168(2.4);3.145(0.5);3.007(1.0);2.045(7.1);1.722(10.8);1.715(13.2);1.688(2.5);1.277(2.6);1.264(1.8);1.260(5.3);1.242(2.3);0.899(0.9);0.882(3.1);0.864(1.2);0.000(13.7)	10
I-20	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.147(0.6);8.130(0.6);8.087(0.6);8.069(0.6);7.526(2.2);7.524(2.3);7.517(3.2);7.512(2.2);7.498(2.4);7.469(1.1);7.465(0.9);7.349(0.6);7.341(0.6);7.334(0.7);7.326(1.0);7.322(0.9);7.315(0.6);7.308(0.6);7.303(0.7);5.756(5.0);4.380(0.6);4.365(1.4);4.359(0.8);4.349(1.0);4.343(1.5);4.327(0.9);4.318(0.8);4.303(0.8);3.911(0.7);3.895(0.7);3.889(0.9);3.873(0.8);3.868(0.7);3.853(0.7);3.847(0.8);3.831(0.7);3.761(1.3);3.740(1.5);3.717(1.6);3.696(1.9);3.678(0.8);3.671(0.7);3.660(0.8);3.647(0.7);3.638(0.6);3.625(0.6);3.390(1.8);3.385(1.7);3.346(1.9);3.341(2.0);3.322(43.8);2.670(0.6);2.544(0.8);2.524(1.3);2.519(2.0);2.510(32.8);2.506(72.0);2.501(100.7);2.497(70.3);2.492(31.4);2.468(0.8);2.456(1.2);2.451(1.0);2.447(1.1);2.436(0.5);2.425(0.7);2.328(0.6);2.048(0.5);1.979(0.6);1.963(0.6);1.947(0.6);1.567(1.4);1.534(16.0);0.000(1.8)	
I-21	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 7.428(4.5);7.421(1.4);7.410(3.4);7.404(2.6);7.386(0.6);7.381(0.5);6.160(1.0);6.153(0.9);6.134(1.1);6.126(1.0);6.117(1.2);6.110(1.1);6.091(1.2);6.083(1.0);5.398(2.3);5.396(1.5);5.355(2.1);5.316(2.1);5.288(2.0);4.376(0.6);4.367(0.8);4.360(1.0);4.354(1.0);4.351(1.2);4.346(1.3);4.339(1.0);4.330(1.3);4.314(0.5);4.056(1.0);4.038(3.2);4.020(3.2);4.003(1.1);3.908(0.7);3.893(1.6);3.887(1.0);3.880(1.5);3.871(0.8);3.862(0.6);3.856(0.8);3.849(1.5);3.840(0.8);3.835(1.7);3.667(1.4);3.653(1.3);3.645(1.2);3.631(1.1);3.601(0.6);3.574(3.0);3.530(2.6);3.431(1.9);2.670(0.7);2.524(2.1);2.519(3.0);2.510(39.7);2.506(85.1);2.501(118.3);2.496(82.4);2.492(36.6);2.476(0.6);2.464(0.6);2.453(0.8);2.432(0.6);2.332(0.5);2.328(0.7);2.323(0.5);2.014(0.6);2.005(0.7);1.996(0.6);1.988(16.0);1.973(0.6);1.908(1.7);1.760(0.5);1.356(0.8);1.192(4.1);1.175(8.3);1.157(4.0);0.000(3.8)	20
I-22	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.262(46.3);7.180(2.1);7.174(2.4);7.171(1.4);7.164(1.4);7.160(2.4);7.154(1.9);6.904(0.8);6.888(0.9);6.882(1.5);6.877(0.7);6.860(0.7);6.176(2.0);6.150(2.2);6.133(2.4);6.106(2.4);5.560(1.8);5.559(1.8);5.544(1.7);5.543(1.7);5.517(1.6);5.516(1.6);5.501(1.5);5.500(1.4);5.358(1.6);5.356(1.6);5.344(1.5);5.342(1.4);5.331(1.4);5.330(1.4);5.317(1.4);5.316(1.4);5.300(2.9);4.586(0.5);4.579(0.6);4.576(1.1);4.566(1.1);4.559(1.1);4.552(1.3);4.543(0.8);4.535(0.9);4.526(0.8);4.056(0.8);4.043(0.9);4.041(0.8);4.033(1.3);4.028(0.8);4.020(1.3);4.017(1.3);4.004(1.1);3.953(0.6);3.951(0.7);3.947(0.7);3.945(0.6);3.930(1.0);3.927(1.0);3.921(2.4);3.899(2.0);3.878(2.2);3.856(2.1);3.814(15.6);3.801(16.0);3.323(1.8);3.313(1.9);3.280(1.6);3.270(1.6);2.556(0.5);2.549(0.5);2.547(0.5);2.541(0.5);2.539(0.6);2.532(0.6);2.530(0.6);2.515(0.5);2.512(0.6);2.095(0.6);2.052(0.6);2.044(0.6);1.569(13.8);0.008(0.6);0.000(18.2);-0.008(0.5)	30
I-23	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.519(0.6);7.269(0.5);7.268(0.6);7.267(0.7);7.266(0.9);7.266(1.1);7.265(1.4);7.264(1.9);7.263(2.5);7.260(105.9);7.256(1.7);7.255(1.3);7.254(1.0);7.253(0.7);7.252(0.9);7.210(0.9);7.200(1.1);7.195(1.2);7.192(0.7);7.184(0.7);7.181(1.3);7.175(1.1);6.996(0.6);6.896(0.5);6.890(0.9);6.189(0.9);6.162(1.1);6.146(1.2);6.119(1.2);5.647(1.7);5.646(1.7);5.604(1.5);5.603(1.5);5.428(1.6);5.401(1.4);5.299(1.3);5.217(1.1);5.206(2.1);5.194(1.2);4.754(1.1);4.742(2.3);4.732(0.8);4.730(0.9);4.318(0.6);4.301(1.9);4.300(1.9);4.283(2.0);4.283(2.0);4.265(0.7);3.942(1.7);3.898(1.9);3.367(1.6);3.324(1.4);1.539(16.0);1.371(3.2);1.353(6.7);1.335(3.1);0.008(1.1);0.000(41.6);-0.005(0.7);-0.006(0.6);-0.008(1.3)	40

10

20

30

40

50

I-24	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 10.908(1.1);7.260(57.2);7.210(0.8);7.194(2.0);7.189(2.4);7.178(1.7);7.175(2.4);7.169(1.8);6.907(0.8);6.891(1.0);6.885(1.6);6.879(0.8);6.869(0.5);6.863(0.8);5.299(0.6);5.222(1.3);5.211(2.4);5.205(2.5);5.200(1.6);5.194(1.3);4.757(1.6);4.751(1.9);4.745(2.2);4.741(2.3);4.738(2.0);4.728(1.3);4.324(0.8);4.319(0.8);4.306(2.4);4.301(2.4);4.288(2.5);4.283(2.4);4.270(0.9);4.265(0.8);4.189(0.7);4.171(2.0);4.153(2.0);4.135(0.8);4.121(5.1);3.852(1.4);3.836(2.9);3.820(1.5);3.793(2.8);3.756(8.4);3.750(3.5);3.254(3.0);3.211(2.6);2.655(1.4);2.638(2.6);2.622(1.3);1.777(16.0);1.554(4.9);1.370(5.0);1.352(10.2);1.335(5.0);1.285(2.5);1.267(4.9);1.257(1.0);1.249(2.5);0.008(1.3);0.000(23.4);-0.008(1.1)	
I-25	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.266(0.5);7.263(16.6);7.200(1.2);7.196(0.8);7.194(1.3);7.190(0.7);7.183(0.7);7.180(1.4);7.177(0.7);7.174(1.1);6.907(0.5);6.891(0.6);6.885(1.1);6.879(0.5);6.863(0.5);5.300(1.8);5.218(0.6);5.211(0.8);5.207(1.1);5.200(1.3);5.196(0.8);5.189(0.7);4.753(1.0);4.746(1.0);4.743(1.1);4.741(1.3);4.736(1.2);4.734(1.0);4.731(0.9);4.724(0.8);4.120(3.7);3.854(1.3);3.838(2.9);3.822(2.0);3.818(16.0);3.794(1.9);3.756(6.7);3.751(2.3);3.706(7.2);3.257(1.9);3.214(1.7);2.672(1.0);2.656(1.9);2.640(0.9);1.779(10.8);1.574(2.0);0.000(7.0)	10
I-26	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.520(1.9);7.311(0.9);7.291(0.8);7.261(352.0);7.255(0.8);7.254(0.7);7.210(2.5);7.183(1.3);7.177(1.5);7.174(1.6);7.169(1.5);7.166(1.5);7.163(1.5);7.160(1.3);7.157(1.6);7.155(1.4);7.149(1.1);6.997(2.5);6.977(0.6);6.920(0.8);6.915(0.8);6.904(0.6);6.899(1.6);6.893(1.5);6.887(0.6);6.877(0.8);6.871(0.8);6.181(1.1);6.174(1.0);6.154(1.2);6.147(1.2);6.138(1.2);6.131(1.3);6.111(1.2);6.104(1.2);5.562(1.8);5.561(1.7);5.552(1.7);5.550(1.8);5.519(1.5);5.517(1.6);5.508(1.5);5.507(1.6);5.372(1.5);5.360(1.6);5.344(1.4);5.333(1.5);5.300(2.3);4.729(0.6);4.720(0.7);4.212(1.1);4.190(1.8);4.167(5.4);4.026(0.8);4.019(0.8);4.011(0.8);4.002(1.1);3.995(1.0);3.987(1.1);3.980(0.8);3.943(0.9);3.936(1.9);3.925(2.0);3.921(1.8);3.905(1.6);3.897(0.8);3.893(2.4);3.882(2.8);3.739(16.0);3.717(0.7);3.711(1.3);3.698(15.8);3.687(0.7);3.678(0.6);3.580(1.9);3.336(2.1);3.294(1.8);3.146(0.8);3.128(2.6);3.110(2.6);3.091(0.8);1.628(2.0);1.382(2.6);1.363(5.4);1.345(2.5);1.284(0.6);1.254(0.9);0.008(4.1);0.000(145.8);-0.006(1.2);-0.008(4.2);-0.050(1.2)	20
I-27	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.262(46.2);7.212(0.8);7.210(1.0);7.204(1.3);7.200(1.1);7.194(0.9);7.190(1.3);7.184(1.1);7.180(0.6);6.909(0.9);6.903(0.8);5.300(3.9);4.258(0.6);4.236(1.0);4.214(0.8);4.035(0.6);4.026(0.8);4.011(0.8);3.936(0.5);3.920(1.0);3.901(1.2);3.874(1.1);3.856(1.4);3.796(0.9);3.788(0.6);3.775(0.6);3.765(0.6);3.758(7.8);3.744(8.3);3.736(3.6);3.719(3.6);3.362(7.7);3.356(6.1);3.354(8.9);3.345(1.2);3.343(0.7);3.337(1.2);3.321(0.5);3.300(1.0);3.292(1.0);1.558(16.0);0.008(0.5);0.000(18.3)	30
I-28	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.262(57.6);7.179(0.6);7.174(1.0);7.169(1.5);7.165(1.8);7.160(1.6);7.154(1.3);7.149(1.6);7.146(1.2);7.144(0.9);7.140(0.8);6.916(0.6);6.910(0.5);6.901(0.7);6.895(1.2);6.889(1.0);6.879(0.8);6.873(0.8);6.867(0.5);5.300(8.2);4.704(0.5);4.695(0.5);4.202(1.1);4.181(1.2);4.158(0.5);4.038(0.6);4.023(0.6);4.021(0.6);4.014(1.1);3.999(1.2);3.990(0.7);3.976(0.9);3.949(0.6);3.934(0.7);3.926(0.6);3.922(0.7);3.910(0.6);3.906(0.7);3.899(0.5);3.883(0.5);3.790(1.4);3.778(1.3);3.773(0.8);3.755(0.7);3.746(12.8);3.737(6.4);3.730(1.3);3.723(0.5);3.703(0.8);3.695(0.8);3.691(11.2);3.678(0.5);3.662(0.5);3.542(5.0);3.211(1.9);3.188(0.9);3.167(1.6);3.144(0.8);1.722(7.6);1.715(10.9);1.688(4.0);1.563(16.0);0.008(0.7);0.000(23.2);-0.008(0.6)	40

10

20

30

40

50

I-29	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.558(1.3);7.553(7.2);7.549(10.9);7.544(5.8);7.445(1.8);7.444(1.8);7.440(3.4);7.439(3.2);7.436(2.2);7.263(38.3);7.005(0.6);6.999(0.6);6.990(0.6);5.300(15.8);4.798(0.6);4.789(0.7);4.783(0.8);4.778(0.7);4.774(0.7);4.770(0.5);4.764(0.7);4.257(1.3);4.235(2.0);4.214(1.5);4.050(0.8);4.047(0.9);4.035(0.9);4.033(0.9);4.025(1.2);4.023(1.2);4.011(1.2);3.961(0.9);3.951(1.0);3.945(1.0);3.938(0.9);3.936(1.1);3.927(1.0);3.924(2.0);3.912(0.9);3.906(1.9);3.879(2.1);3.860(2.2);3.806(0.8);3.798(1.1);3.787(1.0);3.783(0.7);3.774(0.9);3.763(0.9);3.757(15.3);3.744(16.0);3.736(3.1);3.722(3.0);3.354(14.7);3.350(4.7);3.347(16.0);3.340(2.4);3.337(0.8);3.332(2.2);3.294(1.9);3.287(1.9);3.077(0.6);3.066(0.8);3.061(0.6);3.056(0.6);3.050(0.8);2.045(0.8);1.575(11.7);1.259(0.6);0.000(15.0)	
I-30	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.394(0.9);7.390(1.4);7.388(1.2);7.374(3.6);7.371(2.6);7.368(2.0);7.366(2.7);7.261(68.0);7.144(0.7);7.128(0.7);7.121(0.7);4.548(0.7);4.538(0.7);4.522(0.8);4.512(0.8);4.498(0.7);4.489(0.7);4.296(1.3);4.293(1.3);4.278(1.4);4.275(1.3);4.248(0.9);4.230(2.8);4.213(2.9);4.195(1.0);4.079(0.6);4.065(0.6);4.055(1.0);4.042(0.9);4.034(0.6);4.021(0.6);4.010(0.8);3.997(0.8);3.968(0.6);3.963(0.6);3.802(1.6);3.789(1.4);3.759(1.9);3.746(1.6);3.221(1.5);3.213(1.7);3.178(1.3);3.170(1.5);2.561(0.5);2.526(0.5);1.708(9.2);1.684(8.0);1.554(16.0);1.360(2.8);1.342(5.8);1.325(2.7);1.296(3.2);1.278(6.7);1.260(3.3);0.008(0.7);0.000(24.6);-0.008(0.7)	10
I-31	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.520(1.5);7.343(1.5);7.322(1.6);7.305(1.7);7.284(1.9);7.261(268.6);7.179(1.2);7.177(1.2);7.166(5.7);7.164(8.0);7.161(9.1);7.158(8.3);7.147(8.5);7.144(8.8);7.141(7.4);7.139(5.1);7.129(1.0);6.997(1.5);6.906(1.3);6.900(2.2);6.896(1.6);6.890(2.3);6.884(3.3);6.878(4.5);6.874(3.2);6.869(4.3);6.863(3.1);6.857(2.3);6.853(1.6);6.847(2.1);6.841(0.9);6.168(4.3);6.156(4.4);6.141(4.9);6.130(5.1);6.124(5.4);6.113(5.2);6.098(5.5);6.086(5.4);5.544(7.8);5.543(6.8);5.532(7.5);5.531(6.8);5.501(6.8);5.500(6.0);5.489(6.7);5.355(7.2);5.346(7.0);5.328(6.8);5.319(6.4);5.299(16.0);4.609(3.9);4.598(7.8);4.588(5.5);4.585(6.1);4.575(8.8);4.565(5.7);4.553(2.3);4.546(2.1);4.540(1.5);4.527(1.2);4.380(0.5);4.150(1.0);4.132(2.6);4.115(2.7);4.103(3.0);4.097(1.2);4.090(3.0);4.079(7.4);4.066(7.2);4.056(4.9);4.042(4.5);4.012(3.1);4.007(3.1);3.988(2.1);3.983(4.6);3.976(3.1);3.958(1.9);3.952(1.8);3.926(7.3);3.915(7.6);3.884(8.4);3.872(8.6);3.698(0.6);3.332(7.6);3.325(7.6);3.289(6.6);3.282(6.7);2.681(1.5);2.664(1.6);2.657(1.6);2.646(2.1);2.640(3.3);2.629(2.0);2.623(3.4);2.616(1.7);2.605(3.7);2.599(1.8);2.588(1.8);2.582(1.8);2.564(1.6);2.226(1.3);2.219(2.1);2.210(1.3);2.192(1.2);2.184(3.0);2.176(3.1);2.167(1.4);2.150(1.1);2.141(1.8);2.133(1.1);2.116(4.1);2.046(10.8);1.432(3.6);1.304(1.2);1.277(5.0);1.265(5.9);1.259(10.0);1.242(3.6);0.899(3.2);0.882(11.0);0.864(4.2);0.008(2.5);0.000(95.7);-0.008(2.8)	20
I-32	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.487(0.6);7.466(0.7);7.434(0.6);7.399(1.6);7.395(1.9);7.392(1.6);7.388(1.8);7.383(1.7);7.380(1.8);7.375(5.0);7.372(5.4);7.370(5.0);7.366(5.9);7.360(2.1);7.357(2.4);7.261(58.8);7.149(0.5);7.146(0.6);7.139(1.0);7.134(0.9);7.126(1.2);7.122(1.1);7.119(1.2);7.113(1.0);7.107(0.9);7.102(0.5);5.144(1.2);5.128(1.6);5.112(1.2);5.091(0.5);5.075(1.3);5.060(1.7);5.044(1.3);5.028(0.5);4.602(0.6);4.595(0.9);4.588(1.1);4.582(1.0);4.577(1.1);4.570(1.1);4.563(0.9);4.557(0.7);4.550(0.5);4.503(1.1);4.493(1.2);4.478(1.8);4.468(1.9);4.454(1.3);4.444(1.3);4.082(1.1);4.068(1.1);4.059(1.8);4.045(1.6);4.032(1.1);4.018(1.1);4.008(1.5);3.995(1.4);3.967(1.1);3.961(1.1);3.944(0.8);3.937(0.7);3.889(1.0);3.882(1.0);3.865(0.7);3.859(0.7);3.803(2.8);3.791(2.5);3.760(3.2);3.748(2.9);3.221(2.8);3.212(3.1);3.178(2.4);3.169(2.7);2.599(0.6);2.581(0.6);2.576(0.6);2.565(0.7);2.558(0.7);2.555(0.7);2.547(0.7);2.541(0.7);2.536(0.7);2.531(0.7);2.523(0.7);2.520(0.8);2.513(0.7);2.502(0.7);2.497(0.7);2.478(0.6);2.056(0.7);2.022(0.6);1.958(0.8);1.923(0.7);1.708(16.0);1.685(14.4);1.569(9.5);1.327(7.3);1.314(8.2);1.311(8.4);1.299(7.5);1.290(8.2);1.274(8.0);1.262(0.6);1.255(0.6);1.247(0.5);1.212(8.0);1.196(7.9);0.008(0.6);0.000(19.7);-0.008(0.8)	30

I-33	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.519(0.7);7.387(0.5);7.373(0.8);7.364(1.0);7.352(0.6);7.260(128.7);6.996(0.7);3.797(0.5);3.754(0.6);3.743(0.5);3.220(0.5);3.211(0.6);3.177(0.5);3.168(0.5);1.918(0.6);1.704(3.4);1.682(3.1);1.540(16.0);1.520(9.8);1.465(10.8);1.369(0.6);1.335(0.6);1.255(0.9);1.134(0.5);1.106(0.5);0.008(1.6);0.000(47.3);-0.008(1.9)	
I-34	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.483(0.6);7.464(0.6);7.448(0.6);7.427(0.5);7.402(1.0);7.387(4.8);7.384(4.6);7.376(4.5);7.369(7.4);7.365(7.2);7.352(3.1);7.347(1.8);7.340(1.0);7.331(1.5);7.328(1.1);7.318(15.6);7.260(69.1);7.151(0.5);7.142(0.8);7.135(0.8);7.128(1.1);7.123(1.0);7.120(1.4);7.114(1.1);7.108(0.8);7.103(0.5);7.097(0.7);5.304(1.3);5.274(3.0);5.228(3.0);5.197(1.4);5.182(5.2);5.179(5.6);4.591(0.6);4.586(1.6);4.576(1.8);4.566(2.2);4.563(2.0);4.556(2.1);4.553(1.8);4.542(1.6);4.533(1.3);4.091(1.1);4.077(1.1);4.068(1.7);4.054(1.6);4.040(1.0);4.026(1.0);4.016(1.4);4.002(1.3);3.968(1.1);3.961(1.1);3.944(0.7);3.938(0.7);3.897(0.9);3.890(0.9);3.874(0.6);3.866(0.6);3.803(2.8);3.785(2.4);3.760(3.2);3.742(2.7);3.213(2.8);3.210(3.3);3.170(2.4);3.167(2.8);2.602(0.5);2.584(0.6);2.579(0.5);2.568(0.6);2.561(0.6);2.556(0.6);2.550(0.6);2.544(0.7);2.538(0.7);2.533(0.7);2.527(0.6);2.522(0.8);2.515(0.7);2.503(0.7);2.498(0.7);2.480(0.6);2.079(0.7);2.045(0.6);2.019(0.8);1.984(0.7);1.701(16.0);1.647(13.2);1.560(16.4);0.008(0.8);0.000(23.7);-0.008(0.7)	10
I-35	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.519(1.7);7.477(1.5);7.452(2.5);7.430(1.8);7.260(283.4);7.228(5.0);7.210(0.7);7.173(8.0);7.158(8.0);6.996(1.6);6.901(2.3);6.880(4.7);6.858(2.4);6.175(3.6);6.148(4.0);6.132(4.4);6.105(4.5);5.558(4.5);5.540(5.0);5.515(3.9);5.497(4.4);5.354(4.2);5.335(4.9);5.328(4.3);5.309(4.5);4.595(2.6);4.546(2.4);4.537(2.8);4.530(2.5);4.522(4.5);4.513(2.8);4.507(2.6);4.498(2.3);4.292(2.1);4.274(7.8);4.256(11.6);4.238(7.8);4.221(2.2);4.061(1.8);4.048(2.0);4.038(3.5);4.024(3.5);4.017(3.5);4.004(3.1);3.947(2.4);3.922(8.1);3.900(6.2);3.879(4.8);3.857(5.2);3.320(5.1);3.310(4.6);3.277(4.4);3.267(4.1);2.588(1.1);2.570(1.4);2.564(1.6);2.554(1.7);2.547(1.7);2.536(2.5);2.530(2.1);2.520(1.4);2.512(1.7);2.484(1.2);2.072(2.0);2.031(2.4);1.990(1.5);1.537(40.6);1.350(8.0);1.332(16.0);1.318(9.5);1.314(9.5);1.300(14.6);1.282(7.4);1.258(1.3);0.146(0.5);0.000(103.5)	20
I-36	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.518(1.5);7.460(2.0);7.435(1.3);7.260(234.7);7.226(0.6);7.211(1.0);7.174(5.8);7.160(5.8);6.996(1.3);6.900(1.5);6.878(3.1);6.856(1.6);6.176(2.8);6.150(3.0);6.133(3.2);6.106(3.4);5.560(3.3);5.544(3.5);5.518(2.9);5.501(3.0);5.354(3.2);5.329(5.3);5.303(3.1);5.142(0.6);5.126(1.5);5.110(2.1);5.102(1.7);5.095(1.8);5.086(2.0);5.071(1.6);5.055(0.6);4.602(2.0);4.502(1.6);4.493(2.0);4.487(1.9);4.478(3.1);4.470(2.0);4.464(1.9);4.455(1.6);4.064(1.3);4.050(1.4);4.040(3.4);4.027(3.4);4.016(2.2);4.003(2.0);3.946(1.9);3.923(5.9);3.901(4.2);3.880(3.4);3.858(3.5);3.320(3.4);3.310(3.4);3.277(3.0);3.267(3.0);2.583(0.8);2.549(1.2);2.531(1.8);2.501(1.2);2.478(0.8);2.026(1.4);1.985(2.1);1.949(1.2);1.536(39.5);1.318(10.2);1.304(16.0);1.298(13.5);1.290(11.4);1.282(11.1);1.256(1.2);1.240(9.5);1.224(9.5);0.000(88.1)	30

I-37	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.469(0.8);7.448(1.4);7.428(0.8);7.385(3.1);7.383(3.4);7.379(3.7);7.372(9.3);7.359(2.1); 7.350(2.5);7.338(3.4);7.332(18.3);7.308(0.6);7.260(75.8);7.192(0.6);7.186(0.7);7.180(2. 2);7.174(4.2);7.169(3.1);7.164(2.5);7.159(3.2);7.154(4.1);7.148(2.1);7.142(0.7);6.902(0. 9);6.897(0.9);6.891(0.9);6.886(1.3);6.880(1.8);6.875(1.7);6.869(1.7);6.864(1.2);6.859(0. 9);6.853(0.9);6.848(0.8);6.168(1.6);6.152(1.6);6.141(1.7);6.125(3.4);6.109(1.9);6.098(1. 9);6.082(1.9);5.552(3.0);5.537(2.9);5.509(2.6);5.494(2.5);5.348(2.8);5.321(3.0);5.318(3. 1);5.291(2.6);5.274(1.4);5.252(1.5);5.244(4.8);5.220(7.7);5.198(4.8);5.189(1.5);5.167(1. 4);4.618(0.8);4.611(1.0);4.604(1.0);4.598(1.3);4.592(1.3);4.585(2.3);4.576(3.4);4.567(2. 0);4.562(1.8);4.553(3.0);4.544(1.4);4.074(1.3);4.060(1.2);4.050(2.8);4.036(2.5);4.025(1. 9);4.012(1.8);3.954(1.3);3.947(1.3);3.930(2.2);3.921(4.2);3.906(1.0);3.898(3.7);3.878(3. 4);3.855(3.3);3.318(3.1);3.306(3.1);3.275(2.7);3.263(2.7);2.590(0.6);2.573(0.7);2.567(0. 7);2.560(0.8);2.556(0.9);2.549(0.8);2.542(0.9);2.538(1.3);2.532(0.9);2.526(0.9);2.519(0. 8);2.515(0.8);2.508(0.8);2.502(0.8);2.484(0.7);2.072(0.6);2.065(1.0);2.058(0.6);2.051(0. 7);2.043(1.1);2.037(1.0);2.022(0.6);2.017(0.6);2.009(0.9);2.002(0.5);1.554(16.0);0.008(1.0);0.000(27.3);-0.008(1.0)	10
I-38	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.518(16.0);7.454(1.7);7.321(2.2);7.297(3.1);7.260(2792.7);7.230(2.9);7.210(9.5);7.201(2.0);7.177(3.3);7.172(3.7);7.166(4.1);7.160(5.6);7.146(5.5);6.996(15.6);6.898(1.8);6.876 (2.8);6.175(3.9);6.148(3.6);6.132(4.2);6.105(3.9);5.559(4.5);5.540(4.0);5.516(4.3);5.497 (3.5);5.349(4.3);5.321(6.3);5.293(3.2);4.610(1.9);4.432(1.7);4.423(2.4);4.418(2.3);4.409 (3.9);4.399(2.0);4.394(2.5);4.385(2.2);4.065(2.1);4.052(2.5);4.042(3.3);4.028(3.7);4.011 (3.4);3.944(2.3);3.915(6.8);3.894(5.0);3.872(6.0);3.852(4.5);3.493(1.9);3.319(4.5);3.308 (5.1);3.276(3.8);3.265(4.4);2.535(1.8);2.517(1.8);2.501(2.1);2.481(1.6);1.949(5.4);1.915 (4.5);1.713(4.1);1.679(5.0);1.617(2.8);1.593(2.8);1.574(3.2);1.537(678.7);1.505(87.4);1. 479(101.8);1.398(2.3);1.369(5.2);1.335(5.1);1.306(3.1);1.254(13.8);1.193(2.0);1.166(3.2);1.135(4.2);1.105(4.8);1.079(4.0);0.880(1.7);0.146(3.5);0.008(31.6);0.000(1031.9);- 0.008(30.7);-0.050(3.7);-0.150(3.8)	20
I-39	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.5181 (3.2); 7.3998 (1.1); 7.3867 (2.5); 7.3811 (3.4); 7.3771 (3.1); 7.3707 (3.0); 7.3616 (1.5); 7.3073 (0.9); 7.2880 (0.9); 7.2592 (562.4); 7.2336 (0.7); 7.2088 (1.0); 7.2001 (0.6); 7.1603 (1.1); 7.1383 (0.9); 7.1308 (0.7); 7.1227 (0.8); 6.9953 (3.6); 5.9486 (1.8); 5.9409 (1.8); 5.8861 (1.1); 5.8789 (1.1); 5.2426 (0.8); 5.2314 (0.6); 5.2211 (0.6); 5.2124 (0.5); 4.6185 (0.6); 4.6035 (0.8); 4.5964 (0.6); 4.5766 (1.0); 4.5539 (0.8); 4.3293 (0.6); 4.3195 (0.6); 4.3024 (0.6); 4.2342 (1.1); 4.2240 (1.1); 4.2074 (1.0); 4.1973 (0.9); 3.8522 (13.3); 3.8423 (8.0); 3.8080 (1.2); 3.7891 (1.8); 3.7649 (1.3); 3.7458 (2.1); 3.6913 (0.6); 3.2485 (2.1); 3.2434 (1.4); 3.2052 (1.8); 3.2001 (1.1); 2.4632 (1.1); 2.3297 (1.0); 1.7155 (16.0); 1.7038 (0.8); 1.5291 (89.5); 1.3237 (0.8); 1.3064 (0.7); 1.2559 (0.7); 0.1460 (0.9); 0.0079 (6.9); -0.0002 (200.7); -0.0084 (6.5); -0.1498 (0.9)	30

I-40	¹ H-NMR(599.8 MHz, CDCl ₃): δ = 7.4820 (2.4); 7.4684 (2.5); 7.4487 (2.4); 7.4353 (2.4); 7.4046 (1.0); 7.3998 (1.3); 7.3962 (1.2); 7.3915 (4.1); 7.3866 (6.8); 7.3826 (9.1); 7.3816 (9.1); 7.3780 (12.0); 7.3758 (12.0); 7.3717 (12.8); 7.3672 (14.8); 7.3579 (2.5); 7.3553 (2.1); 7.2849 (5.3); 7.1506 (1.4); 7.1462 (2.9); 7.1436 (2.9); 7.1419 (2.6); 7.1381 (2.7); 7.1367 (2.7); 7.1321 (5.0); 7.1279 (4.7); 7.1212 (3.0); 7.1167 (2.7); 7.1124 (1.3); 7.1078 (0.3); 4.6805 (0.5); 4.6718 (1.5); 4.6672 (2.4); 4.6634 (3.0); 4.6594 (3.4); 4.6550 (3.8); 4.6512 (3.5); 4.6473 (2.9); 4.6429 (2.4); 4.6393 (1.7); 4.6298 (0.6); 4.1557 (3.8); 4.1474 (3.9); 4.1401 (4.8); 4.1318 (4.5); 4.1271 (3.8); 4.1185 (3.8); 4.1113 (4.4); 4.1027 (4.1); 4.0077 (0.3); 3.9767 (3.9); 3.9624 (3.1); 3.9614 (3.1); 3.9010 (3.4); 3.8990 (3.6); 3.8867 (50.0); 3.8552 (49.2); 3.8453 (0.8); 3.8328 (2.0); 3.8078 (0.4); 3.7963 (7.8); 3.7759 (7.7); 3.7675 (8.7); 3.7607 (0.6); 3.7471 (8.3); 3.7291 (0.3); 3.3491 (48.2); 3.3405 (48.2); 3.2449 (0.4); 3.2368 (8.2); 3.2253 (8.6); 3.2186 (0.7); 3.2163 (0.6); 3.2080 (7.5); 3.2021 (0.6); 3.1965 (7.7); 2.5589 (3.2); 2.5468 (3.4); 2.5351 (3.9); 2.5231 (3.7); 2.5024 (3.4); 2.4902 (3.5); 2.4785 (4.0); 2.4664 (3.8); 2.2319 (2.9); 2.2308 (3.0); 2.2264 (3.0); 2.2082 (2.6); 2.2071 (2.6); 2.2027 (2.6); 2.1546 (2.9); 2.1533 (3.0); 2.1493 (3.1); 2.1481 (2.9); 2.1307 (2.6); 2.1294 (2.7); 2.1255 (2.8); 1.8553 (1.3); 1.7169 (40.5); 1.6954 (39.1); 1.3373 (0.8); 1.2871 (1.3); 1.2573 (3.3); 0.8920 (0.4); 0.8808 (0.9); 0.8689 (0.5); 0.8424 (0.3); -0.0001 (4.5)	10
I-41	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.5185 (0.9); 7.3305 (0.6); 7.3101 (0.9); 7.2935 (0.8); 7.2901 (0.8); 7.2596 (159.2); 7.1701 (0.7); 7.1642 (0.6); 7.1577 (3.3); 7.1520 (4.0); 7.1488 (2.3); 7.1411 (2.2); 7.1378 (4.0); 7.1322 (3.3); 7.1197 (0.5); 6.9956 (0.9); 6.8966 (0.8); 6.8885 (0.8); 6.8808 (1.0); 6.8749 (1.6); 6.8668 (1.7); 6.8609 (0.9); 6.8532 (0.8); 6.8451 (0.8); 5.2983 (0.6); 4.6116 (1.2); 4.6013 (1.4); 4.5885 (2.0); 4.5793 (1.9); 4.5660 (1.5); 4.5561 (1.7); 4.5443 (0.8); 4.5381 (0.9); 4.5332 (0.9); 4.5265 (0.9); 4.5204 (0.9); 4.5131 (0.8); 4.5085 (0.5); 4.1133 (1.1); 4.1002 (1.1); 4.0894 (2.0); 4.0763 (1.9); 4.0733 (1.4); 4.0599 (1.2); 4.0492 (1.8); 4.0357 (2.0); 4.0261 (1.2); 4.0094 (0.7); 4.0022 (0.7); 3.9682 (1.1); 3.9624 (1.1); 3.9441 (0.7); 3.9372 (0.7); 3.7796 (2.9); 3.7729 (2.9); 3.7363 (3.3); 3.7296 (3.3); 3.1984 (3.0); 3.1935 (3.0); 3.1551 (2.6); 3.1502 (2.7); 2.6774 (0.6); 2.6601 (0.7); 2.6537 (0.6); 2.6427 (0.8); 2.6365 (0.7); 2.6257 (0.8); 2.6191 (0.8); 2.6112 (0.6); 2.6048 (0.7); 2.6020 (0.8); 2.5939 (0.8); 2.5875 (0.7); 2.5766 (0.7); 2.5703 (0.7); 2.5529 (0.6); 2.2721 (1.0); 2.2378 (0.7); 2.1741 (0.8); 2.1396 (0.7); 2.1109 (7.6); 1.7027 (15.9); 1.6873 (16.0); 1.4319 (4.0); 1.2567 (0.7); 0.8820 (0.9); 0.0080 (1.5); -0.0002 (46.7); -0.0085 (1.4)	20
I-42	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.5186 (1.0); 7.5024 (0.6); 7.4829 (0.6); 7.4416 (0.8); 7.4215 (0.8); 7.2598 (167.2); 7.2093 (0.6); 7.1693 (2.1); 7.1639 (2.6); 7.1496 (3.8); 7.1370 (2.2); 7.1315 (1.8); 6.9958 (0.9); 6.8933 (1.0); 6.8888 (1.0); 6.8772 (1.0); 6.8718 (2.0); 6.8669 (2.0); 6.8554 (0.6); 6.8500 (1.0); 6.8454 (0.9); 4.5805 (1.1); 4.4363 (1.2); 4.4274 (1.4); 4.4131 (2.3); 4.4042 (2.4); 4.3899 (1.1); 4.3808 (1.1); 4.0768 (0.9); 4.0631 (0.9); 4.0533 (1.5); 4.0394 (1.7); 4.0231 (1.2); 4.0132 (1.7); 3.9994 (1.6); 3.9694 (1.1); 3.9633 (1.2); 3.9467 (0.8); 3.9395 (0.7); 3.8931 (1.3); 3.8869 (1.4); 3.8694 (0.9); 3.8631 (1.1); 3.7676 (2.2); 3.7564 (2.7); 3.7244 (2.6); 3.7133 (3.1); 3.1860 (2.9); 3.1770 (2.6); 3.1428 (2.6); 3.1338 (2.3); 2.5651 (0.6); 2.5472 (0.7); 2.5417 (0.7); 2.5311 (1.0); 2.5239 (0.8); 2.5127 (1.1); 2.4992 (0.7); 2.4910 (1.0); 2.4807 (0.7); 2.4756 (0.7); 2.4573 (0.6); 2.2528 (0.6); 2.0199 (1.0); 1.9855 (0.9); 1.9132 (0.8); 1.8784 (0.7); 1.7070 (13.3); 1.6833 (16.0); 1.5392 (24.4); 1.5194 (53.5); 1.4680 (43.6); 1.4445 (0.7); 1.4275 (0.7); 1.2552 (0.7); 1.2049 (0.7); 1.1885 (0.8); 1.1827 (2.5); 1.1713 (2.3); 1.1525 (1.0); 1.1368 (1.0); 0.0079 (2.2); -0.0002 (58.9)	30
		40

I-43	¹ H-NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 7.5219 (0.6); 7.5011 (0.7); 7.4886 (0.7); 7.4681 (0.6); 7.2990 (1.4); 7.1903 (0.5); 7.1780 (2.9); 7.1724 (3.6); 7.1691 (2.1); 7.1616 (2.1); 7.1580 (3.6); 7.1525 (2.9); 7.1460 (0.5); 7.1402 (0.5); 6.9069 (0.7); 6.9011 (1.3); 6.8953 (0.7); 6.8852 (1.5); 6.8794 (2.6); 6.8736 (1.3); 6.8634 (0.8); 6.8577 (1.3); 6.8519 (0.6); 4.6076 (0.6); 4.6031 (0.7); 4.6008 (0.6); 4.5967 (0.8); 4.5933 (0.7); 4.5899 (1.0); 4.5867 (0.9); 4.5832 (1.0); 4.5761 (0.8); 4.5727 (0.7); 4.5697 (0.7); 4.5660 (0.6); 4.5590 (0.6); 4.5559 (1.3); 4.5466 (1.4); 4.5320 (2.2); 4.5226 (2.2); 4.5082 (1.3); 4.4989 (1.2); 4.3114 (0.9); 4.3099 (1.0); 4.2936 (2.9); 4.2921 (3.0); 4.2757 (3.0); 4.2745 (3.0); 4.2577 (1.1); 4.2567 (1.1); 4.2531 (1.2); 4.2353 (3.7); 4.2176 (3.9); 4.1998 (1.4); 4.0770 (1.1); 4.0638 (1.1); 4.0535 (1.8); 4.0403 (1.7); 4.0340 (1.2); 4.0207 (1.2); 4.0104 (1.7); 3.9971 (1.6); 3.9801 (1.1); 3.9749 (1.0); 3.9734 (1.0); 3.9566 (0.7); 3.9514 (0.6); 3.9499 (0.6); 3.9089 (0.9); 3.9075 (1.0); 3.9024 (1.0); 3.9009 (0.9); 3.8854 (0.6); 3.8838 (0.7); 3.8788 (0.7); 3.8774 (0.6); 3.8340 (1.0); 3.7866 (2.9); 3.7836 (1.3); 3.7732 (2.6); 3.7435 (3.3); 3.7300 (3.0); 3.2065 (2.8); 3.1990 (3.0); 3.1634 (2.5); 3.1559 (2.6); 2.6102 (0.6); 2.5926 (0.6); 2.5868 (0.6); 2.5758 (0.8); 2.5691 (0.8); 2.5665 (0.7); 2.5582 (0.7); 2.5524 (0.8); 2.5484 (0.7); 2.5430 (0.7); 2.5348 (0.8); 2.5320 (0.9); 2.5251 (0.7); 2.5139 (0.7); 2.5086 (0.7); 2.4906 (0.6); 2.1117 (0.8); 2.1095 (0.5); 2.0773 (0.6); 2.0132 (0.8); 2.0063 (0.5); 1.9969 (0.6); 1.9787 (0.7); 1.7143 (16.0); 1.6904 (14.9); 1.3614 (5.6); 1.3436 (11.6); 1.3257 (5.4); 1.3047 (5.8); 1.2869 (12.0); 1.2691 (5.7); 1.2597 (0.8); -0.0002 (1.0)	10
I-44	¹ H-NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 7.5274 (0.7); 7.5067 (0.8); 7.4922 (0.8); 7.4716 (0.7); 7.3034 (1.2); 7.1783 (2.8); 7.1745 (3.5); 7.1728 (3.3); 7.1603 (3.1); 7.1586 (3.6); 7.1548 (2.9); 7.1532 (2.4); 6.9036 (0.6); 6.8991 (1.0); 6.8979 (1.0); 6.8935 (0.6); 6.8922 (0.6); 6.8832 (1.1); 6.8819 (1.3); 6.8774 (2.0); 6.8762 (2.1); 6.8718 (1.1); 6.8704 (1.1); 6.8614 (0.6); 6.8601 (0.7); 6.8558 (1.0); 6.8544 (1.1); 6.8501 (0.5); 6.8488 (0.5); 5.1433 (1.3); 5.1277 (1.8); 5.1120 (1.3); 5.0961 (0.7); 5.0947 (0.7); 5.0788 (1.4); 5.0631 (1.8); 5.0475 (1.4); 5.0318 (0.5); 4.6095 (0.7); 4.6023 (0.9); 4.5987 (0.9); 4.5952 (1.0); 4.5918 (1.1); 4.5889 (1.0); 4.5846 (1.0); 4.5820 (0.9); 4.5779 (0.8); 4.5748 (0.7); 4.5712 (0.6); 4.5124 (1.2); 4.5030 (1.4); 4.4888 (2.5); 4.4793 (2.6); 4.4651 (1.4); 4.4558 (1.3); 4.0796 (1.1); 4.0663 (1.1); 4.0561 (1.9); 4.0428 (1.7); 4.0321 (1.2); 4.0187 (1.1); 4.0085 (1.7); 3.9951 (1.6); 3.9824 (1.2); 3.9765 (1.2); 3.9589 (0.8); 3.9533 (0.7); 3.9036 (1.1); 3.8980 (1.0); 3.8800 (0.7); 3.8745 (0.7); 3.7882 (2.9); 3.7840 (0.5); 3.7769 (2.7); 3.7451 (3.3); 3.7337 (3.1); 3.2084 (2.9); 3.2001 (3.1); 3.1652 (2.6); 3.1569 (2.7); 2.6063 (0.6); 2.5885 (0.6); 2.5830 (0.6); 2.5720 (0.8); 2.5651 (0.7); 2.5610 (0.7); 2.5542 (0.7); 2.5486 (0.8); 2.5428 (0.7); 2.5376 (0.7); 2.5308 (0.7); 2.5265 (0.9); 2.5195 (0.7); 2.5083 (0.7); 2.5032 (0.7); 2.4850 (0.6); 2.0692 (0.8); 2.0622 (0.5); 2.0443 (0.9); 2.0348 (0.8); 1.9781 (0.5); 1.9712 (0.8); 1.9641 (0.5); 1.9626 (0.5); 1.9367 (0.7); 1.7159 (16.0); 1.6923 (15.1); 1.3290 (8.0); 1.3156 (9.6); 1.3136 (9.8); 1.3002 (8.8); 1.2970 (9.4); 1.2812 (8.3); 1.2594 (0.6); 1.2582 (0.6); 1.2217 (8.2); 1.2060 (8.2); -0.0002 (0.9)	20
		30

I-45	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.5182 (1.0); 7.4766 (0.5); 7.4574 (0.6); 7.4411 (0.6); 7.4206 (0.6); 7.4015 (0.8); 7.3897 (2.3); 7.3853 (4.0); 7.3813 (3.4); 7.3750 (1.3); 7.3723 (3.1); 7.3701 (3.5); 7.3646 (1.0); 7.3572 (1.2); 7.3547 (1.7); 7.3514 (1.6); 7.3487 (1.4); 7.3436 (1.0); 7.3313 (2.3); 7.3254 (13.2); 7.3128 (0.7); 7.3062 (0.5); 7.2935 (0.6); 7.2593 (174.4); 7.1696 (1.9); 7.1661 (2.9); 7.1637 (2.9); 7.1604 (3.1); 7.1528 (1.5); 7.1497 (3.0); 7.1463 (2.9); 7.1441 (2.9); 7.1405 (1.8); 6.9953 (1.0); 6.8960 (0.8); 6.8899 (0.8); 6.8839 (0.8); 6.8801 (1.0); 6.8743 (1.6); 6.8682 (1.5); 6.8622 (1.5); 6.8564 (0.9); 6.8526 (0.8); 6.8464 (0.7); 6.8405 (0.8); 5.3028 (1.6); 5.2723 (3.6); 5.2284 (4.1); 5.1973 (5.2); 5.1839 (4.2); 5.1533 (0.8); 4.5944 (0.6); 4.5894 (1.9); 4.5800 (2.0); 4.5765 (1.3); 4.5717 (2.0); 4.5659 (2.1); 4.5626 (2.2); 4.5565 (2.0); 4.5486 (1.6); 4.5391 (1.5); 4.0842 (1.1); 4.0709 (1.1); 4.0607 (1.8); 4.0473 (1.6); 4.0356 (1.2); 4.0222 (1.2); 4.0119 (1.7); 3.9985 (1.5); 3.9693 (1.0); 3.9637 (1.0); 3.9458 (0.7); 3.9399 (0.7); 3.9022 (1.0); 3.8967 (1.0); 3.8785 (0.7); 3.8731 (0.7); 3.7711 (2.8); 3.7541 (2.8); 3.7280 (3.2); 3.7110 (3.2); 3.1777 (3.1); 3.1733 (3.1); 3.1346 (2.7); 3.1302 (2.7); 2.5979 (0.6); 2.5800 (0.6); 2.5746 (0.6); 2.5634 (0.8); 2.5563 (1.0); 2.5456 (0.7); 2.5400 (0.8); 2.5373 (0.8); 2.5321 (0.7); 2.5212 (1.1); 2.5141 (0.7); 2.5027 (0.7); 2.4976 (0.7); 2.4795 (0.6); 2.0772 (0.8); 2.0428 (0.7); 2.0327 (0.7); 2.0231 (0.8); 1.9886 (0.7); 1.7099 (0.6); 1.7009 (16.0); 1.6443 (16.0); 1.5408 (30.6); 1.2557 (0.5); 0.0080 (1.9); -0.0002 (61.3); -0.0085 (1.8)	10
I-46	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.5183 (1.2); 7.4000 (1.1); 7.3866 (2.4); 7.3814 (3.3); 7.3772 (3.0); 7.3726 (2.5); 7.3705 (3.1); 7.3650 (1.1); 7.3617 (1.4); 7.2595 (199.8); 7.1662 (0.6); 7.1600 (0.8); 7.1475 (0.6); 7.1451 (0.7); 7.1368 (0.8); 7.1305 (0.6); 7.1224 (0.8); 6.9954 (1.5); 5.9487 (1.6); 5.9411 (1.6); 5.8864 (1.3); 5.8787 (1.3); 5.2429 (0.6); 5.2304 (0.6); 5.2226 (0.6); 5.2204 (0.5); 5.2104 (0.5); 4.6454 (0.6); 4.6231 (0.6); 4.6189 (0.7); 4.6036 (0.7); 4.5963 (0.6); 4.5807 (0.7); 4.5768 (0.9); 4.5542 (0.7); 4.3294 (0.8); 4.3197 (0.8); 4.3027 (0.7); 4.2930 (0.7); 4.2343 (1.0); 4.2243 (1.0); 4.2075 (0.9); 4.1975 (0.9); 3.8592 (0.5); 3.8520 (14.0); 3.8421 (11.8); 3.8082 (1.5); 3.7892 (1.8); 3.7649 (1.7); 3.7459 (2.1); 3.2487 (2.0); 3.2436 (1.7); 3.2054 (1.7); 3.2003 (1.4); 2.0436 (1.1); 1.7157 (16.0); 1.5330 (11.1); 1.2765 (0.5); 1.2586 (1.3); 0.8819 (0.8); 0.0080 (2.3); -0.0002 (73.4); -0.0085 (2.2)	20
I-47	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.4477 (0.6); 7.4344 (0.6); 7.4155 (0.7); 7.4110 (0.7); 7.3960 (1.4); 7.3912 (1.9); 7.3889 (1.7); 7.3826 (2.0); 7.3779 (2.5); 7.3722 (3.0); 7.3673 (5.3); 7.3610 (3.5); 7.3520 (0.6); 7.3479 (0.5); 7.2625 (29.8); 7.1554 (0.8); 7.1497 (0.8); 7.1456 (0.5); 7.1421 (0.5); 7.1393 (0.6); 7.1352 (0.9); 7.1310 (1.0); 7.1277 (0.8); 7.1255 (0.8); 7.1172 (0.6); 7.1118 (0.6); 4.6657 (0.6); 4.6604 (0.7); 4.6525 (0.8); 4.6474 (0.8); 4.6402 (0.7); 4.6346 (0.6); 4.1581 (1.0); 4.1458 (1.0); 4.1345 (1.4); 4.1303 (1.1); 4.1222 (1.2); 4.1175 (1.0); 4.1066 (1.2); 4.0938 (1.1); 3.9763 (0.8); 3.9514 (0.7); 3.8892 (15.7); 3.8757 (0.8); 3.8727 (0.8); 3.8703 (0.7); 3.8592 (16.0); 3.8414 (0.8); 3.8008 (2.1); 3.7795 (2.0); 3.7576 (2.3); 3.7363 (2.3); 3.3514 (15.6); 3.3424 (15.2); 3.2389 (2.2); 3.2272 (2.2); 3.1956 (1.9); 3.1839 (1.9); 2.5668 (0.8); 2.5487 (0.9); 2.5311 (1.1); 2.5123 (1.5); 2.4932 (0.9); 2.4755 (1.1); 2.4573 (1.0); 2.2298 (0.7); 2.2275 (0.7); 2.2215 (0.7); 2.2192 (0.7); 2.1941 (0.6); 2.1917 (0.6); 2.1858 (0.6); 2.1834 (0.6); 2.1532 (0.7); 2.1506 (0.7); 2.1453 (0.7); 2.1428 (0.7); 2.1173 (0.6); 2.1148 (0.6); 2.1095 (0.6); 2.1069 (0.6); 1.7164 (11.9); 1.6946 (11.4); -0.0002 (10.0)	30

40

I-48	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.2618 (68.4); 7.1797 (0.5); 7.1715 (2.4); 7.1676 (3.6); 7.1620 (2.6); 7.1571 (2.1); 7.1543 (2.6); 7.1518 (3.5); 7.1480 (3.2); 7.1419 (1.5); 7.1353 (0.5); 6.9978 (0.9); 6.9792 (0.6); 6.9142 (0.8); 6.9086 (0.8); 6.9056 (0.5); 6.9037 (0.6); 6.8982 (1.2); 6.8925 (1.8); 6.8869 (1.5); 6.8839 (0.9); 6.8819 (1.0); 6.8779 (1.3); 6.8766 (1.4); 6.8708 (1.3); 6.8653 (0.8); 6.8603 (0.5); 6.8564 (0.6); 6.8549 (0.6); 4.6416 (0.6); 4.6209 (1.4); 4.6031 (1.4); 4.5801 (1.3); 4.5744 (0.8); 4.5703 (1.2); 4.5610 (0.8); 4.5555 (2.0); 4.5462 (1.7); 4.5369 (0.9); 4.5310 (1.5); 4.5221 (1.0); 4.1650 (0.9); 4.1522 (0.9); 4.1411 (1.1); 4.1359 (1.0); 4.1283 (1.0); 4.1230 (0.9); 4.1119 (1.1); 4.0989 (1.0); 4.0662 (0.7); 4.0532 (0.6); 4.0426 (1.1); 4.0299 (1.6); 4.0172 (0.8); 4.0066 (1.0); 3.9935 (1.0); 3.9680 (0.7); 3.9635 (0.6); 3.9010 (0.6); 3.8965 (0.6); 3.8555 (0.7); 3.8515 (0.6); 3.8489 (0.6); 3.8342 (13.9); 3.8276 (0.9); 3.8252 (0.8); 3.7909 (2.6); 3.7856 (13.6); 3.7738 (2.0); 3.7706 (2.5); 3.7654 (14.3); 3.7570 (2.4); 3.7505 (14.2); 3.7307 (2.1); 3.7273 (2.4); 3.7137 (2.0); 3.2132 (2.0); 3.2095 (2.1); 3.1912 (1.8); 3.1832 (1.8); 3.1699 (1.8); 3.1661 (1.8); 3.1480 (1.6); 3.1400 (1.5); 2.5651 (0.5); 2.5591 (0.7); 2.5418 (0.8); 2.5247 (0.8); 2.4160 (0.7); 2.3990 (0.9); 2.3863 (0.8); 2.3818 (1.2); 2.3692 (0.9); 2.3644 (0.6); 2.3520 (1.0); 2.3345 (0.5); 1.7167 (16.0); 1.7106 (10.7); 1.6878 (9.8); 1.5652 (8.8); 0.0080 (0.7); -0.0002 (24.5); -0.0085 (0.8)	10
I-49	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.2603 (79.2); 7.2105 (0.5); 7.1993 (1.7); 7.1949 (2.3); 7.1797 (2.3); 7.1755 (1.7); 6.9331 (0.8); 6.9171 (0.9); 6.9113 (1.6); 6.9056 (0.8); 6.8897 (0.8); 4.6474 (0.7); 4.6423 (0.7); 4.6307 (0.7); 4.6268 (0.7); 4.6214 (0.5); 4.5982 (0.8); 4.5903 (0.9); 4.5751 (1.2); 4.5676 (1.4); 4.5526 (0.9); 4.5445 (0.8); 4.0667 (0.7); 4.0543 (0.8); 4.0430 (2.0); 4.0304 (1.9); 4.0191 (1.3); 4.0063 (1.2); 3.9783 (0.7); 3.9749 (0.8); 3.9636 (0.7); 3.9575 (1.0); 3.8276 (15.4); 3.8151 (0.9); 3.8010 (16.0); 3.7826 (1.4); 3.7706 (1.3); 3.6729 (2.3); 3.6505 (2.1); 3.6285 (1.3); 3.6061 (1.3); 2.5764 (0.5); 2.5591 (0.5); 2.5562 (0.5); 2.5526 (0.5); 2.5354 (0.6); 2.5325 (0.5); 2.5212 (0.5); 2.4976 (0.5); 2.1028 (0.5); 2.0811 (0.6); 2.0730 (0.6); 2.0436 (0.8); 1.8128 (2.2); 1.7968 (2.1); 1.7659 (4.4); 1.7498 (4.2); 1.7190 (2.4); 1.7029 (2.3); 1.5438 (17.9); 0.0080 (1.2); -0.0002 (41.5); -0.0085 (1.2)	20
I-50	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.5191 (1.2); 7.4723 (1.2); 7.4535 (1.2); 7.3606 (0.6); 7.3094 (0.5); 7.2779 (0.6); 7.2771 (0.6); 7.2763 (0.7); 7.2755 (0.7); 7.2739 (0.9); 7.2731 (1.0); 7.2723 (1.1); 7.2715 (1.2); 7.2707 (1.3); 7.2699 (1.4); 7.2691 (1.6); 7.2683 (1.8); 7.2675 (2.0); 7.2602 (205.8); 7.2530 (1.5); 7.2521 (1.2); 7.2513 (0.9); 7.2505 (0.8); 7.2497 (0.7); 7.2489 (0.6); 7.2481 (0.5); 7.2095 (0.6); 7.1932 (0.6); 7.1876 (0.6); 7.1801 (2.8); 7.1761 (3.4); 7.1608 (3.7); 7.1568 (2.5); 6.9962 (1.2); 6.9293 (0.9); 6.9228 (1.0); 6.9138 (1.0); 6.9077 (2.0); 6.9011 (2.0); 6.8952 (0.9); 6.8862 (0.9); 6.8795 (1.0); 4.6357 (1.2); 4.6266 (1.5); 4.6216 (0.8); 4.6114 (3.1); 4.6023 (3.8); 4.5877 (2.2); 4.5785 (2.0); 4.5726 (0.7); 4.1498 (1.2); 4.1320 (3.5); 4.1195 (1.2); 4.1141 (3.7); 4.1069 (1.1); 4.0958 (2.9); 4.0884 (1.2); 4.0828 (1.9); 4.0755 (1.0); 4.0641 (1.9); 4.0511 (1.8); 4.0386 (1.3); 4.0335 (1.3); 4.0142 (1.8); 3.9952 (0.6); 3.9901 (0.6); 3.8220 (1.4); 3.8138 (1.3); 3.7775 (2.8); 3.7742 (3.7); 3.7681 (3.2); 3.7638 (2.3); 3.7574 (6.6); 3.7514 (2.2); 3.7471 (1.5); 3.7400 (3.4); 3.7221 (2.1); 3.7046 (0.8); 3.6642 (4.8); 3.6196 (2.8); 2.6928 (0.6); 2.6757 (0.6); 2.6688 (0.6); 2.6580 (0.8); 2.6518 (0.7); 2.6410 (0.7); 2.6342 (0.9); 2.6177 (1.0); 2.6123 (0.7); 2.6012 (0.9); 2.5951 (0.7); 2.5840 (0.8); 2.5775 (0.7); 2.5602 (0.7); 2.2473 (0.5); 2.2406 (0.8); 2.2307 (0.7); 2.2207 (0.9); 2.2137 (0.9); 2.2058 (0.8); 2.1948 (0.6); 2.1859 (0.7); 2.1136 (1.6); 2.0456 (16.0); 1.8760 (2.4); 1.8683 (2.2); 1.8594 (7.1); 1.8546 (1.5); 1.8505 (2.2); 1.8428 (2.4); 1.8042 (3.1); 1.7864 (2.9); 1.7572 (6.5); 1.7392 (5.8); 1.7104 (3.5); 1.6924 (3.1); 1.4320 (1.1); 1.2772 (4.6); 1.2655 (2.4); 1.2593 (9.4); 1.2480 (4.5); 1.2414 (4.9); 1.2391 (2.8); 1.2304 (2.2); 0.0079 (2.0); -0.0002 (64.7); -0.0068 (0.9); -0.0085 (2.1)	30

I-51	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.7312 (1.0); 7.7094 (1.0); 7.6924 (1.0); 7.6716 (0.9); 7.5189 (1.4); 7.2929 (0.5); 7.2600 (265.2); 7.2108 (1.2); 7.1984 (4.5); 7.1938 (5.8); 7.1788 (5.7); 7.1742 (4.5); 7.1616 (0.8); 6.9960 (1.5); 6.9329 (1.0); 6.9290 (1.6); 6.9271 (1.6); 6.9213 (0.9); 6.9130 (1.9); 6.9112 (2.0); 6.9073 (3.2); 6.9055 (3.2); 6.9016 (1.7); 6.8997 (1.6); 6.8914 (1.0); 6.8896 (1.0); 6.8856 (1.6); 6.8838 (1.6); 6.8799 (0.8); 5.1532 (0.9); 5.1375 (2.3); 5.1218 (3.1); 5.1099 (1.1); 5.1061 (2.4); 5.0943 (2.4); 5.0905 (1.1); 5.0786 (3.2); 5.0629 (2.3); 5.0472 (0.9); 4.6923 (0.5); 4.6866 (0.5); 4.6798 (0.9); 4.6744 (1.0); 4.6690 (1.0); 4.6633 (1.2); 4.6582 (1.3); 4.6518 (1.3); 4.6457 (1.3); 4.6399 (1.2); 4.6247 (0.9); 4.6183 (0.5); 4.6122 (0.5); 4.5188 (2.0); 4.5104 (2.3); 4.5028 (2.2); 4.4948 (4.4); 4.4867 (2.1); 4.4794 (2.2); 4.4711 (2.1); 4.0691 (1.8); 4.0564 (1.8); 4.0453 (3.2); 4.0366 (2.0); 4.0327 (3.1); 4.0236 (1.8); 4.0127 (3.1); 3.9996 (2.9); 3.9768 (1.8); 3.9730 (1.8); 3.9471 (2.8); 3.9426 (1.9); 3.9232 (1.1); 3.9188 (1.0); 3.8237 (2.0); 3.8157 (2.1); 3.7792 (3.4); 3.7713 (3.6); 3.6777 (5.6); 3.6551 (5.5); 3.6332 (3.2); 3.6107 (3.3); 2.6051 (1.0); 2.5872 (1.0); 2.5813 (1.0); 2.5702 (1.3); 2.5635 (1.1); 2.5526 (1.2); 2.5465 (1.3); 2.5431 (1.1); 2.5287 (1.2); 2.5250 (1.2); 2.5195 (1.1); 2.5081 (1.3); 2.5016 (1.1); 2.4902 (1.2); 2.4847 (1.2); 2.4667 (1.0); 2.0339 (1.4); 2.0308 (1.7); 2.0283 (1.8); 2.0257 (1.6); 2.0227 (1.5); 1.9991 (1.3); 1.9934 (1.5); 1.9877 (1.3); 1.8128 (5.2); 1.7970 (5.2); 1.7659 (10.6); 1.7500 (10.5); 1.7191 (5.7); 1.7032 (5.7); 1.5429 (43.8); 1.4474 (0.6); 1.3265 (13.4); 1.3108 (14.3); 1.3062 (16.0); 1.3037 (16.0); 1.2905 (15.3); 1.2880 (15.4); 1.2553 (0.8); 1.2437 (13.2); 1.2280 (13.0); 0.0079 (3.5); -0.0002 (112.0); -0.0085 (3.3)	10
I-52	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.5190 (1.4); 7.4491 (1.9); 7.4333 (2.6); 7.4159 (1.9); 7.3658 (1.7); 7.3512 (1.9); 7.3461 (3.2); 7.3323 (3.9); 7.3263 (2.8); 7.3188 (2.1); 7.3122 (4.5); 7.2989 (3.4); 7.2938 (2.8); 7.2793 (2.8); 7.2731 (1.4); 7.2690 (2.2); 7.2683 (2.4); 7.2601 (236.0); 7.2109 (0.6); 7.1919 (0.6); 7.1861 (1.2); 7.1777 (1.8); 7.1738 (5.6); 7.1679 (7.8); 7.1653 (10.5); 7.1624 (8.6); 7.1597 (9.8); 7.1570 (6.8); 7.1541 (7.7); 7.1483 (8.9); 7.1456 (8.8); 7.1433 (6.9); 7.1400 (6.9); 7.1275 (1.3); 7.1177 (4.0); 7.1162 (4.0); 7.1138 (3.4); 7.1049 (2.8); 7.1009 (3.7); 7.0998 (3.7); 7.0972 (3.3); 7.0868 (1.8); 7.0815 (2.4); 7.0775 (1.9); 7.0581 (2.8); 7.0557 (2.8); 7.0524 (3.4); 7.0342 (4.3); 7.0303 (5.4); 7.0097 (3.4); 6.9961 (1.7); 6.9883 (1.3); 6.9818 (1.0); 6.9085 (1.3); 6.9027 (2.3); 6.8986 (1.7); 6.8929 (2.5); 6.8868 (3.6); 6.8810 (4.6); 6.8769 (3.4); 6.8754 (3.0); 6.8712 (4.7); 6.8653 (3.4); 6.8593 (2.3); 6.8552 (1.7); 6.8495 (2.3); 6.8436 (1.0); 6.1652 (4.5); 6.1552 (4.5); 6.1384 (5.0); 6.1284 (5.0); 6.1221 (5.5); 6.1120 (5.2); 6.0952 (5.6); 6.0852 (5.4); 5.5477 (7.5); 5.5463 (7.7); 5.5327 (7.0); 5.5311 (7.3); 5.5046 (6.7); 5.5032 (6.7); 5.4895 (6.3); 5.4880 (6.3); 5.3488 (6.9); 5.3476 (6.7); 5.3219 (6.6); 5.3207 (7.2); 5.3186 (7.3); 5.3171 (6.7); 5.2917 (5.9); 5.2903 (5.9); 5.2638 (2.6); 5.2385 (2.7); 5.2325 (8.5); 5.2069 (16.0); 5.1880 (8.9); 5.1749 (2.6); 5.1567 (2.3); 4.7085 (0.8); 4.6437 (0.5); 4.6373 (1.0); 4.6307 (1.2); 4.6238 (2.0); 4.6171 (2.5); 4.6101 (2.4); 4.6034 (3.3); 4.5998 (5.6); 4.5916 (8.0); 4.5832 (5.6); 4.5768 (5.0); 4.5683 (6.3); 4.5598 (3.8); 4.0771 (3.3); 4.0638 (3.4); 4.0532 (6.5); 4.0398 (5.8); 4.0283 (4.9); 4.0149 (4.4); 3.9575 (3.0); 3.9524 (2.9); 3.9328 (4.4); 3.9298 (4.6); 3.9257 (11.9); 3.9068 (2.0); 3.8998 (2.3); 3.8953 (8.0); 3.8827 (9.2); 3.8523 (8.9); 3.3196 (7.7); 3.3057 (7.9); 3.2766 (6.7); 3.2627 (6.9); 2.6071 (1.7); 2.5893 (1.8); 2.5837 (1.8); 2.5727 (2.6); 2.5660 (2.0); 2.5569 (2.4); 2.5549 (2.6); 2.5516 (2.5); 2.5494 (2.5); 2.5404 (2.3); 2.5337 (2.3); 2.5317 (2.2); 2.5226 (2.1); 2.5172 (2.0); 2.4993 (1.8); 2.0840 (1.4); 2.0772 (2.3); 2.0687 (2.5); 2.0602 (2.5); 2.0515 (2.4); 2.0427 (2.1); 2.0340 (2.2); 2.0256 (2.1); 2.0190 (1.2); 1.5534 (22.4); 1.2559 (0.7); 0.0079 (3.2); -0.0002 (99.5); - 0.0068 (1.2); -0.0085 (3.0)	20 30 40

I-53	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.4651 (0.6); 7.4434 (0.7); 7.3653 (0.5); 7.3508 (0.5); 7.3455 (0.9); 7.3302 (1.3); 7.3257 (0.9); 7.3140 (0.7); 7.3104 (1.7); 7.2949 (1.2); 7.2900 (0.8); 7.2748 (0.9); 7.2601 (81.2); 7.1746 (1.2); 7.1731 (1.2); 7.1706 (1.4); 7.1641 (1.8); 7.1580 (3.8); 7.1547 (2.9); 7.1521 (3.0); 7.1486 (2.0); 7.1441 (2.2); 7.1416 (2.1); 7.1382 (3.4); 7.1322 (2.0); 7.1257 (0.6); 7.1197 (0.9); 7.1065 (1.3); 7.1051 (1.3); 7.0877 (1.3); 7.0861 (1.2); 7.0463 (0.8); 7.0411 (0.9); 7.0345 (0.9); 7.0311 (1.0); 7.0276 (1.2); 7.0244 (1.0); 7.0176 (0.9); 7.0134 (1.0); 7.0071 (1.2); 6.9962 (0.6); 6.8971 (0.7); 6.8919 (0.7); 6.8863 (0.8); 6.8810 (1.1); 6.8753 (1.4); 6.8702 (1.3); 6.8646 (1.6); 6.8590 (1.0); 6.8536 (0.7); 6.8485 (0.6); 6.8429 (0.8); 5.2928 (1.0); 5.2616 (2.3); 5.2160 (2.6); 5.1836 (4.0); 5.1732 (3.4); 4.6044 (1.4); 4.5953 (1.8); 4.5911 (1.0); 4.5879 (1.8); 4.5845 (1.3); 4.5809 (2.1); 4.5786 (2.4); 4.5716 (1.7); 4.5645 (2.0); 4.5554 (1.4); 4.0874 (1.1); 4.0741 (1.1); 4.0638 (1.8); 4.0506 (1.6); 4.0390 (1.0); 4.0257 (1.0); 4.0153 (1.4); 4.0020 (1.3); 3.9744 (1.0); 3.9688 (1.0); 3.9507 (0.7); 3.9453 (0.6); 3.9040 (0.8); 3.8987 (0.8); 3.8803 (0.6); 3.8749 (0.6); 3.7769 (2.8); 3.7520 (2.3); 3.7337 (3.2); 3.7088 (2.7); 3.1824 (2.5); 3.1760 (2.9); 3.1393 (2.2); 3.1328 (2.6); 2.5968 (0.6); 2.5912 (0.5); 2.5801 (0.7); 2.5734 (0.6); 2.5704 (0.7); 2.5624 (0.6); 2.5567 (0.7); 2.5525 (0.7); 2.5472 (0.7); 2.5389 (0.6); 2.5359 (0.8); 2.5292 (0.7); 2.5179 (0.7); 2.5126 (0.7); 2.4947 (0.6); 2.0911 (0.7); 2.0566 (0.6); 2.0479 (0.8); 2.0396 (0.8); 2.0049 (0.7); 1.7017 (16.0); 1.6504 (13.3); 1.5512 (10.8); 1.2584 (0.5); 0.0079 (1.2); -0.0002 (35.6); -0.0085 (1.0)	10
I-54	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.4531 (0.7); 7.3377 (2.3); 7.3325 (0.8); 7.3212 (0.8); 7.3158 (2.5); 7.3089 (0.5); 7.2925 (2.5); 7.2872 (1.0); 7.2760 (1.0); 7.2706 (2.9); 7.2600 (55.9); 7.1855 (2.2); 7.1798 (2.6); 7.1767 (1.5); 7.1689 (1.5); 7.1657 (2.7); 7.1600 (2.2); 6.9096 (0.6); 6.9032 (3.4); 6.8978 (1.2); 6.8949 (0.8); 6.8869 (1.3); 6.8815 (3.4); 6.8760 (1.1); 6.8732 (1.5); 6.8686 (3.3); 6.8634 (1.0); 6.8603 (0.7); 6.8518 (1.3); 6.8467 (2.8); 6.1708 (1.1); 6.1572 (1.0); 6.1440 (1.2); 6.1304 (1.2); 6.1277 (1.4); 6.1141 (1.2); 6.1009 (1.3); 6.0873 (1.2); 5.5589 (1.9); 5.5575 (1.8); 5.5443 (1.7); 5.5428 (1.7); 5.5157 (1.6); 5.5144 (1.6); 5.5013 (1.5); 5.4997 (1.4); 5.3543 (1.7); 5.3532 (1.6); 5.3315 (1.6); 5.3300 (1.7); 5.3276 (1.7); 5.3264 (1.6); 5.3047 (1.4); 5.3033 (1.4); 5.2078 (0.7); 5.1956 (0.9); 5.1781 (2.3); 5.1658 (2.2); 5.1573 (2.3); 5.1308 (2.3); 5.1011 (0.8); 4.6040 (0.6); 4.5971 (0.5); 4.5907 (0.7); 4.5854 (0.6); 4.5790 (0.5); 4.5723 (0.6); 4.5504 (0.9); 4.5407 (1.5); 4.5311 (1.0); 4.5269 (1.0); 4.5173 (1.6); 4.5078 (0.8); 4.0599 (0.8); 4.0465 (0.8); 4.0361 (1.5); 4.0227 (1.4); 4.0111 (1.1); 3.9977 (1.0); 3.9409 (0.8); 3.9337 (0.8); 3.9301 (2.0); 3.9168 (1.1); 3.9100 (1.1); 3.8965 (1.9); 3.8871 (2.6); 3.8536 (2.1); 3.8127 (16.0); 3.7946 (15.8); 3.3214 (1.8); 3.3109 (1.9); 3.2784 (1.6); 3.2679 (1.7); 2.5341 (0.6); 2.5186 (0.6); 2.5162 (0.6); 2.5137 (0.6); 2.5108 (0.6); 2.5023 (0.5); 2.4955 (0.5); 2.0433 (0.6); 2.0343 (0.5); 2.0089 (0.8); 2.0000 (0.8); 1.5548 (7.2); 1.2584 (0.5); 0.0079 (0.7); -0.0002 (24.0); -0.0085 (0.7)	20 30
I-55	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.2610 (30.5); 7.1737 (1.7); 7.1677 (2.8); 7.1643 (2.5); 7.1617 (2.4); 7.1581 (2.3); 7.1539 (2.6); 7.1515 (2.6); 7.1481 (2.8); 7.1421 (1.7); 6.9968 (1.0); 6.9770 (1.0); 6.9141 (0.8); 6.9087 (0.8); 6.8979 (0.8); 6.8925 (1.6); 6.8870 (1.5); 6.8813 (0.8); 6.8764 (0.6); 6.8708 (0.9); 6.8653 (0.8); 4.6416 (0.6); 4.6215 (1.5); 4.6030 (1.6); 4.5825 (0.8); 4.5490 (1.0); 4.5426 (1.1); 4.5372 (1.1); 4.5306 (1.1); 4.1649 (0.8); 4.1522 (0.8); 4.1410 (1.2); 4.1359 (1.1); 4.1283 (1.2); 4.1230 (1.0); 4.1119 (1.1); 4.0990 (1.0); 3.8549 (0.8); 3.8511 (0.8); 3.8337 (0.8); 3.8271 (0.8); 3.7906 (2.4); 3.7654 (11.5); 3.7505 (11.9); 3.7270 (2.4); 3.2127 (2.2); 3.2093 (2.0); 3.1694 (2.0); 3.1660 (1.8); 2.4160 (0.6); 2.3990 (0.9); 2.3862 (1.0); 2.3819 (1.2); 2.3693 (1.0); 2.3646 (0.7); 2.3521 (1.0); 2.3346 (0.5); 2.2651 (0.6); 2.1767 (0.5); 1.7169 (16.0); 1.5519 (8.1); -0.0002 (13.3)	40

I-56	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.2602 (70.1); 7.1772 (4.1); 7.1582 (4.2); 6.9440 (1.7); 6.9241 (1.5); 6.9183 (1.7); 6.9128 (1.5); 6.8967 (2.4); 6.8913 (2.3); 6.8751 (1.4); 6.8696 (1.3); 6.1887 (1.1); 6.1731 (1.2); 6.1620 (1.3); 6.1460 (2.5); 6.1300 (1.5); 6.1190 (1.4); 6.1032 (1.5); 5.5554 (2.9); 5.5500 (3.0); 5.5122 (2.6); 5.5069 (2.7); 5.3632 (4.1); 5.3365 (3.9); 4.6264 (1.9); 4.6074 (3.2); 4.5884 (2.3); 4.5516 (1.8); 4.1567 (1.2); 4.1438 (1.5); 4.1392 (1.6); 4.1326 (1.8); 4.1263 (1.6); 4.1198 (1.8); 4.1152 (1.8); 4.1025 (1.5); 3.9348 (2.3); 3.9161 (2.4); 3.8917 (2.6); 3.8730 (2.8); 3.8349 (1.3); 3.8153 (2.5); 3.7911 (1.3); 3.7857 (1.3); 3.7620 (15.4); 3.7515 (16.0); 3.3388 (3.9); 3.2956 (3.4); 2.4196 (0.5); 2.4120 (0.6); 2.4024 (1.0); 2.3945 (1.1); 2.3854 (1.5); 2.3775 (1.5); 2.3682 (1.8); 2.3604 (1.8); 2.3507 (1.1); 2.3428 (1.0); 2.2829 (0.7); 2.2757 (0.7); 2.2625 (0.7); 2.2552 (0.8); 2.2273 (1.1); 2.2198 (1.1); 2.2062 (0.8); 2.1984 (0.8); 2.1722 (0.6); 1.5419 (18.5); -0.0002 (29.5)	10
------	---	----

【 0 3 2 0 】

上記で引用され、及び、適切な時点で引用されている調製実施例と同様にして、また、置換されているイソオキサゾリンカルボキサミド類の調製に関する一般的な詳細を考慮して、下記化合物が得られる。

【 0 3 2 1 】

10

20

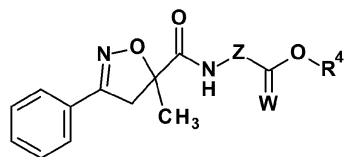
30

40

50

【表 3】

表 2.1: 一般式 (I.1) [式中、Z-(C=W)-O-R⁴ は、以下で定義されているとおりである] で表される本発明の化合物 2.1-1~化合物 2.1-240



(I.1),

表 2.1

No.		No.	
2.1-1		2.1-2	
2.1-3		2.1-4	
2.1-5		2.1-6	
2.1-7		2.1-8	
2.1-9		2.1-10	
2.1-11		2.1-12	
2.1-13		2.1-14	
2.1-15		2.1-16	

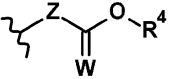
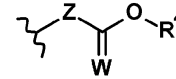
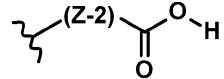
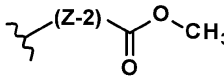
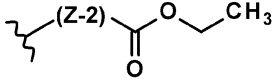
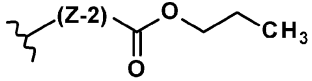
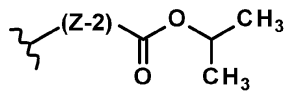
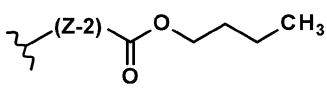
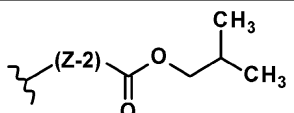
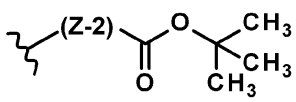
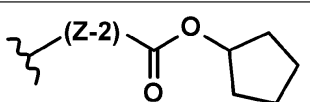
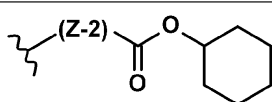
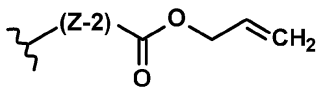
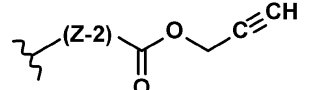
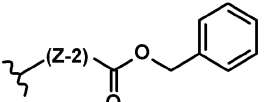
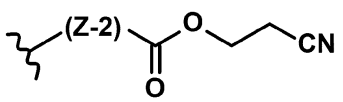
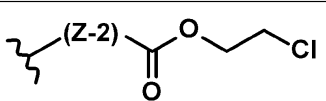
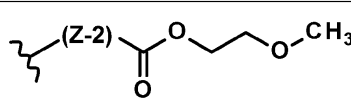
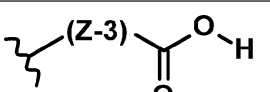
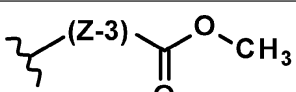
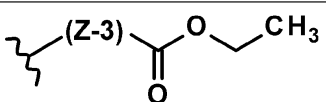
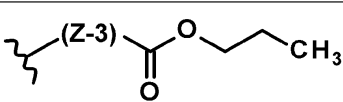
10

20

30

40

50

No.		No.	
2.1-17		2.1-18	
2.1-19		2.1-20	
2.1-21		2.1-22	
2.1-23		2.1-24	
2.1-25		2.1-26	
2.1-27		2.1-28	
2.1-29		2.1-30	
2.1-31		2.1-32	
2.1-33		2.1-34	
2.1-35		2.1-36	

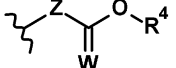
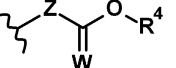
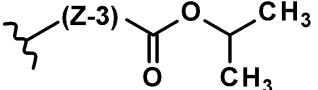
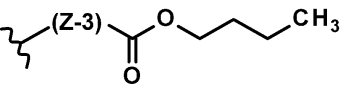
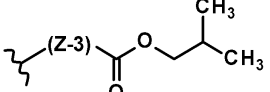
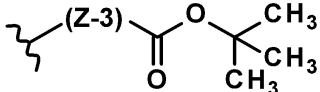
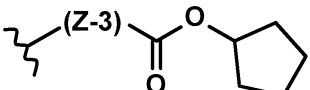
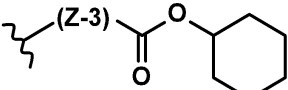
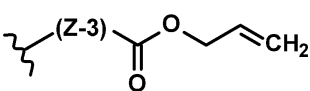
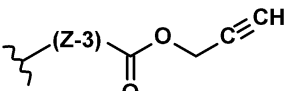
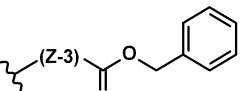
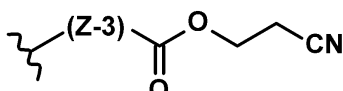
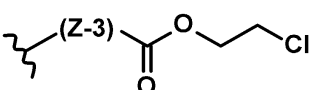
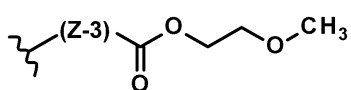
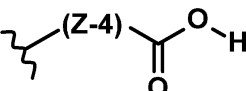
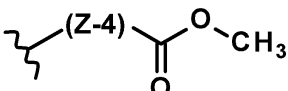
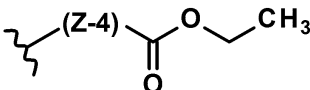
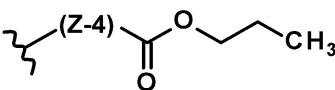
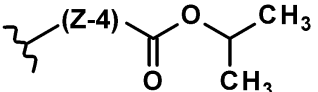
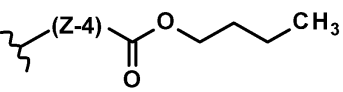
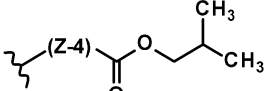
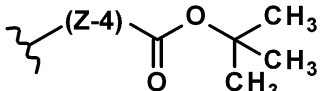
10

20

30

40

50

No.		No.	
2.1-37		2.1-38	
2.1-39		2.1-40	
2.1-41		2.1-42	
2.1-43		2.1-44	
2.1-45		2.1-46	
2.1-47		2.1-48	
2.1-49		2.1-50	
2.1-51		2.1-52	
2.1-53		2.1-54	
2.1-55		2.1-56	

10

20

30

40

50

No.		No.	
2.1-57		2.1-58	
2.1-59		2.1-60	
2.1-61		2.1-62	
2.1-63		2.1-64	
2.1-65		2.1-66	
2.1-67		2.1-68	
2.1-69		2.1-70	
2.1-71		2.1-72	
2.1-73		2.1-74	
2.1-75		2.1-76	

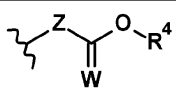
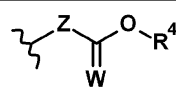
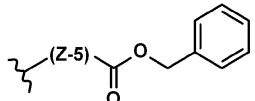
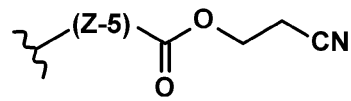
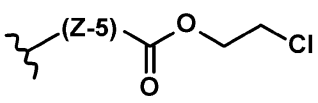
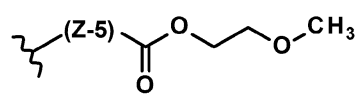
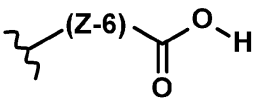
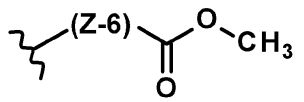
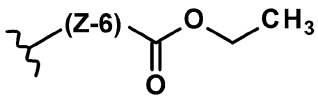
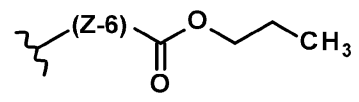
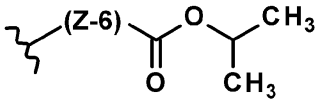
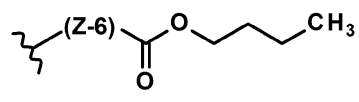
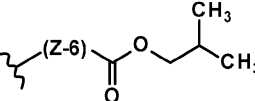
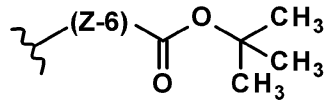
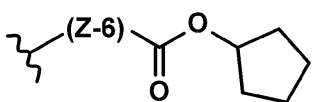
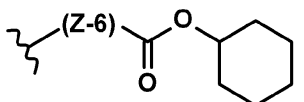
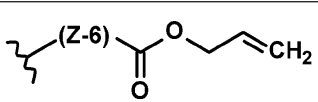
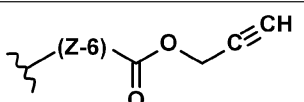
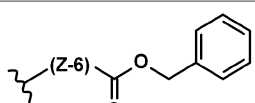
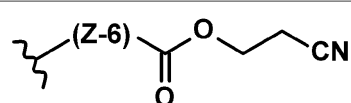
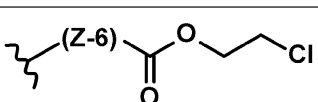
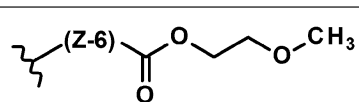
10

20

30

40

50

No.		No.	
2.1-77		2.1-78	
2.1-79		2.1-80	
2.1-81		2.1-82	
2.1-83		2.1-84	
2.1-85		2.1-86	
2.1-87		2.1-88	
2.1-89		2.1-90	
2.1-91		2.1-92	
2.1-93		2.1-94	
2.1-95		2.1-96	

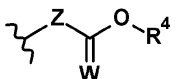
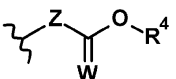
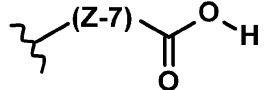
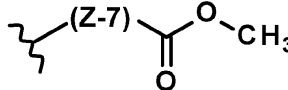
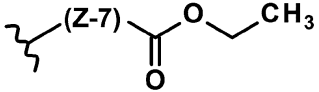
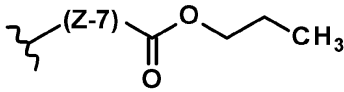
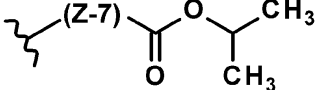
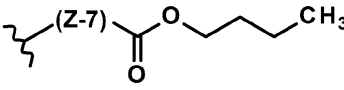
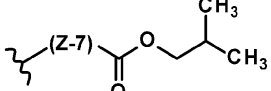
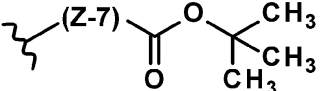
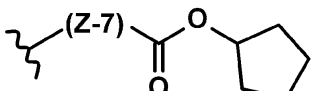
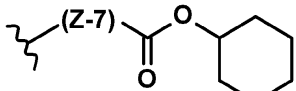
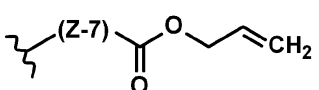
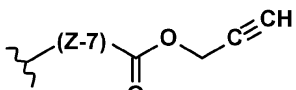
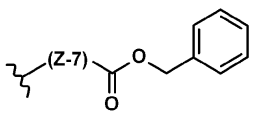
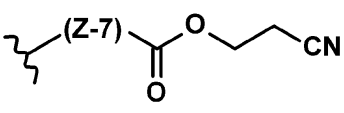
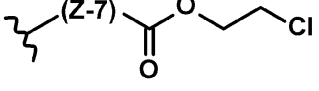
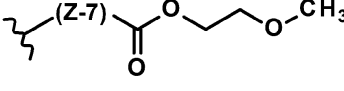
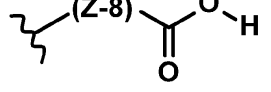
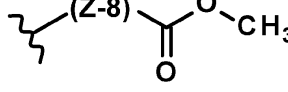
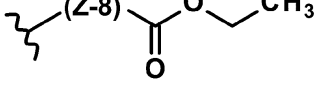
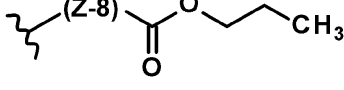
10

20

30

40

50

No.		No.	
2.1-97		2.1-98	
2.1-99		2.1-100	
2.1-101		2.1-102	
2.1-103		2.1-104	
2.1-105		2.1-106	
2.1-107		2.1-108	
2.1-109		2.1-110	
2.1-111		2.1-112	
2.1-113		2.1-114	
2.1-115		2.1-116	

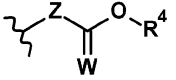
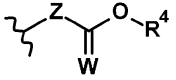
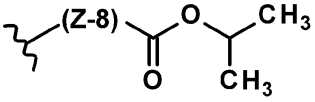
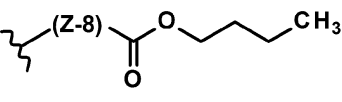
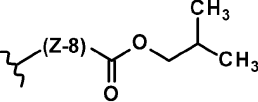
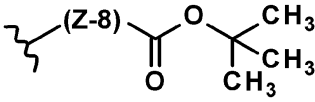
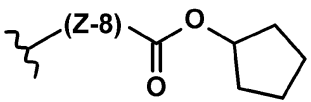
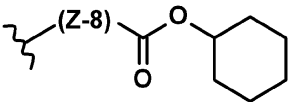
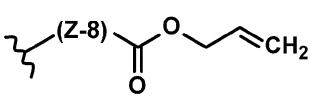
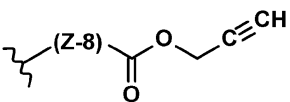
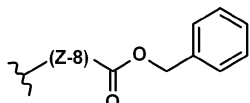
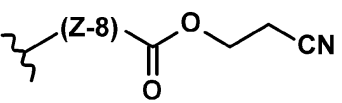
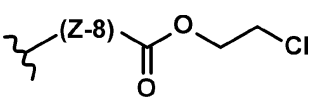
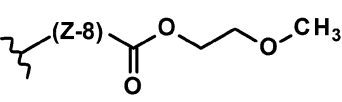
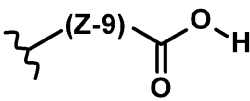
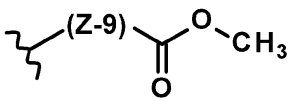
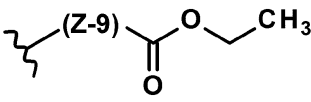
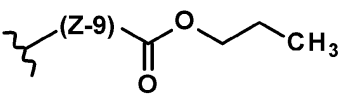
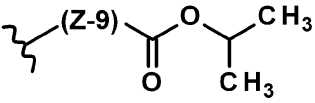
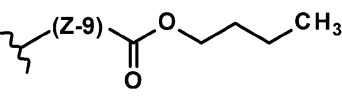
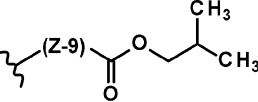
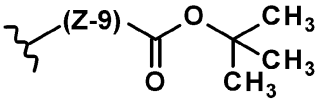
10

20

30

40

50

No.		No.	
2.1-117		2.1-118	
2.1-119		2.1-120	
2.1-121		2.1-122	
2.1-123		2.1-124	
2.1-125		2.1-126	
2.1-127		2.1-128	
2.1-129		2.1-130	
2.1-131		2.1-132	
2.1-133		2.1-134	
2.1-135		2.1-136	

10

20

30

40

50

No.		No.	
2.1-137		2.1-138	
2.1-139		2.1-140	
2.1-141		2.1-142	
2.1-143		2.1-144	
2.1-145		2.1-146	
2.1-147		2.1-148	
2.1-149		2.1-150	
2.1-151		2.1-152	
2.1-153		2.1-154	
2.1-155		2.1-156	

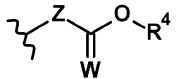
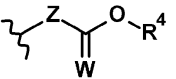
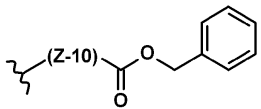
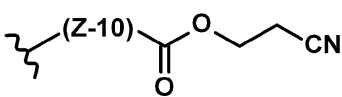
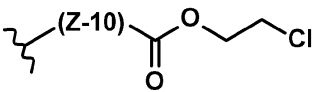
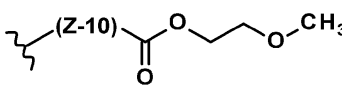
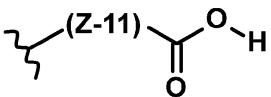
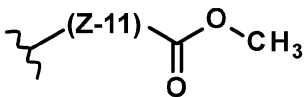
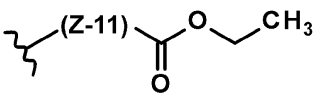
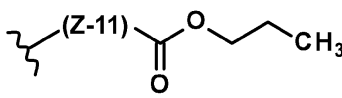
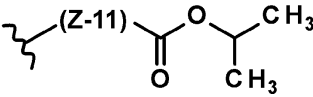
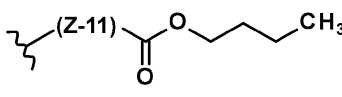
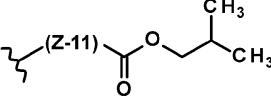
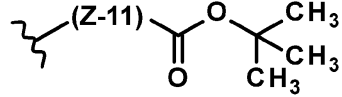
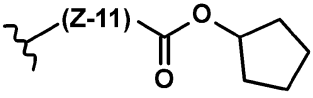
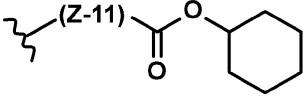
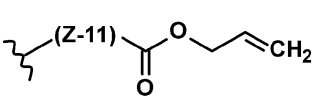
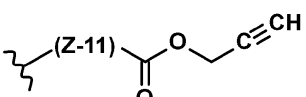
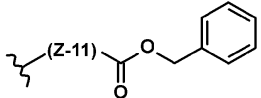
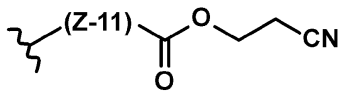
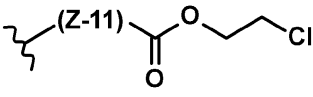
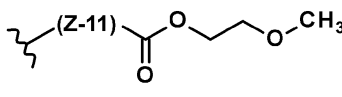
10

20

30

40

50

No.		No.	
2.1-157		2.1-158	
2.1-159		2.1-160	
2.1-161		2.1-162	
2.1-163		2.1-164	
2.1-165		2.1-166	
2.1-167		2.1-168	
2.1-169		2.1-170	
2.1-171		2.1-172	
2.1-173		2.1-174	
2.1-175		2.1-176	

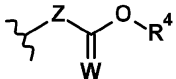
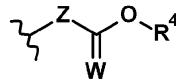
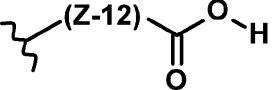
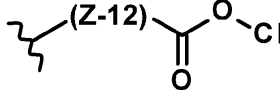
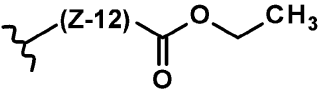
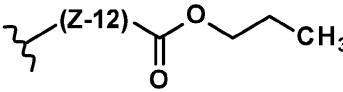
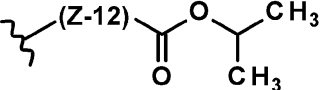
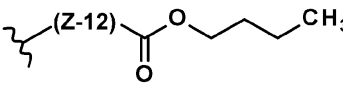
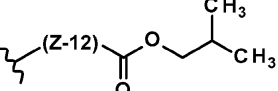
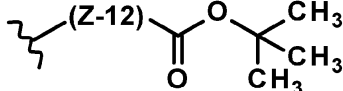
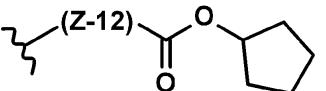
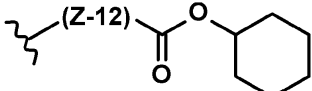
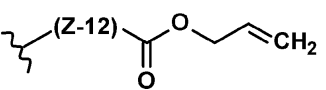
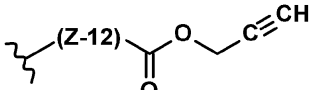
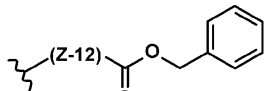
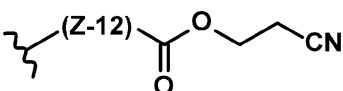
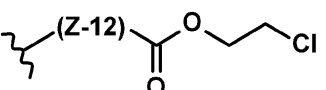
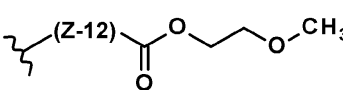
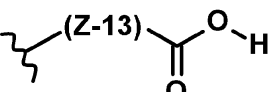
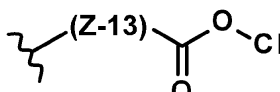
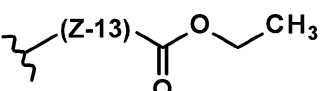
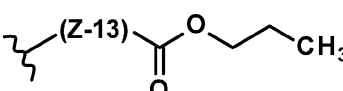
10

20

30

40

50

No.		No.	
2.1-177		2.1-178	
2.1-179		2.1-180	
2.1-181		2.1-182	
2.1-183		2.1-184	
2.1-185		2.1-186	
2.1-187		2.1-188	
2.1-189		2.1-190	
2.1-191		2.1-192	
2.1-193		2.1-194	
2.1-195		2.1-196	

10

20

30

40

50

No.		No.	
2.1-197		2.1-198	
2.1-199		2.1-200	
2.1-201		2.1-202	
2.1-203		2.1-204	
2.1-205		2.1-206	
2.1-207		2.1-208	
2.1-209		2.1-210	
2.1-211		2.1-212	
2.1-213		2.1-214	
2.1-215		2.1-216	

10

20

30

40

50

No.		No.	
2.1-217		2.1-218	
2.1-219		2.1-220	
2.1-221		2.1-222	
2.1-223		2.1-224	
2.1-225		2.1-226	
2.1-227		2.1-228	
2.1-229		2.1-230	
2.1-231		2.1-232	
2.1-233		2.1-234	
2.1-235		2.1-236	

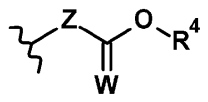
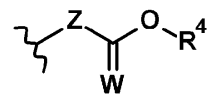
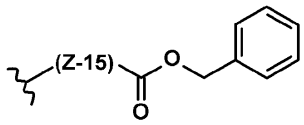
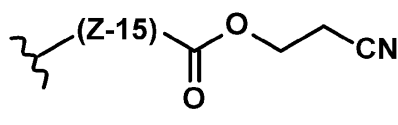
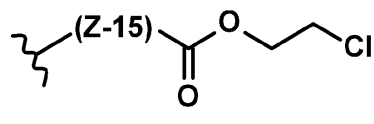
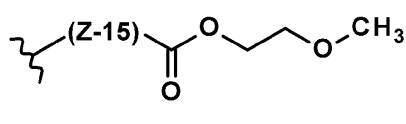
10

20

30

40

50

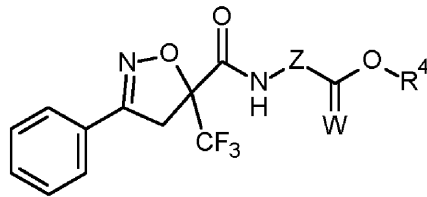
No.		No.	
2.1-237		2.1-238	
2.1-239		2.1-240	

10

【 0 3 2 2 】

表 2 . 2 : 一般式 (I . 2)

【 化 2 6 】



(I.2),

20

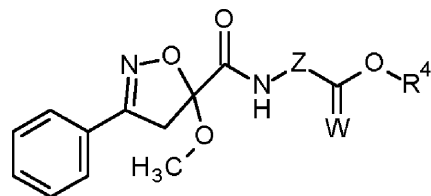
【 0 3 2 3 】

〔 式中、Z - (C = W) - O - R 4 は、表 2 . 1 において定義されているとおりである 〕
で表される本発明の化合物 2 . 2 - 1 ~ 化合物 2 . 2 - 2 4 0 。

【 0 3 2 4 】

表 2 . 3 : 一般式 (I . 3)

【 化 2 7 】



(I.3),

30

【 0 3 2 5 】

〔 式中、Z - (C = W) - O - R 4 は、表 2 . 1 において定義されているとおりである 〕
で表される本発明の化合物 2 . 3 - 1 ~ 化合物 2 . 3 - 2 4 0 。

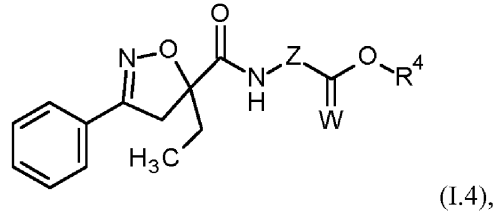
【 0 3 2 6 】

表 2 . 4 : 一般式 (I . 4)

40

50

【化28】



【0327】

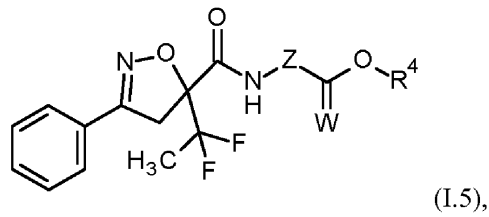
〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2.4-1 ~ 化合物 2.4-240。

10

【0328】

表 2.5 : 一般式 (I.5)

【化29】



20

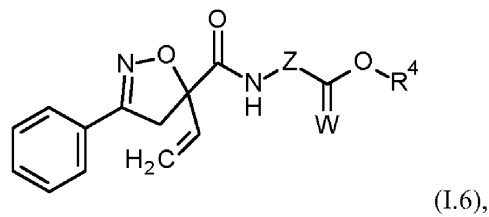
【0329】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2.5-1 ~ 化合物 2.5-240。

【0330】

表 2.6 : 一般式 (I.6)

【化30】



30

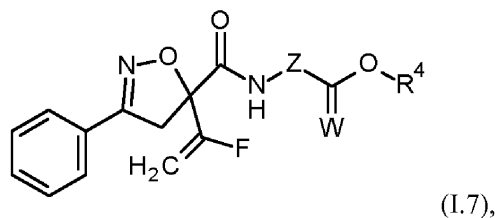
【0331】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2.6-1 ~ 化合物 2.6-240。

【0332】

表 2.7 : 一般式 (I.7)

【化31】



50

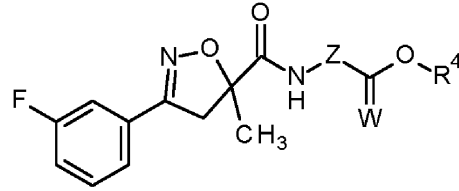
【0333】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.7-1 ~ 化合物 2.7-240。

【0334】

表 2.8 : 一般式 (I.8)

【化 3 2】



(I.8),

10

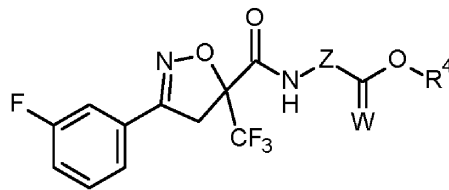
【0335】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.8-1 ~ 化合物 2.8-240。

【0336】

表 2.9 : 一般式 (I.9)

【化 3 3】



(I.9),

20

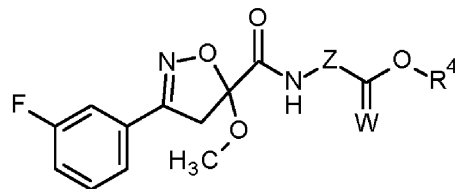
【0337】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.9-1 ~ 化合物 2.9-240。

【0338】

表 2.10 : 一般式 (I.10)

【化 3 4】



(I.10),

40

【0339】

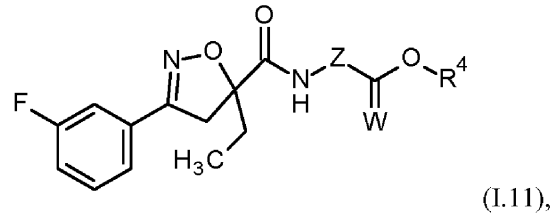
〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.10-1 ~ 化合物 2.10-240。

【0340】

表 2.11 : 一般式 (I.11)

50

【化35】



【0341】

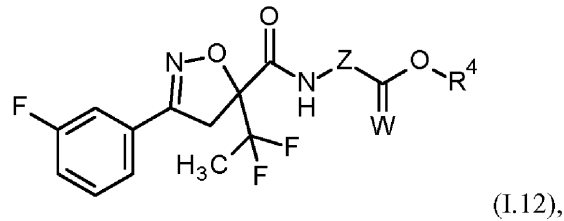
〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2.11-1 ~ 化合物 2.11-240。

10

【0342】

表 2.12 : 一般式 (I.12)

【化36】



20

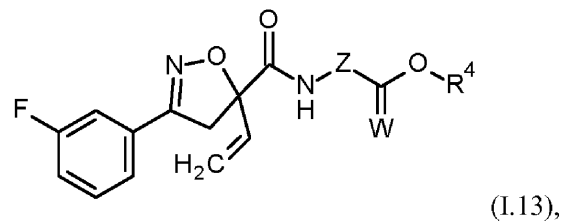
【0343】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2.12-1 ~ 化合物 2.12-240。

【0344】

表 2.13 : 一般式 (I.13)

【化37】



30

【0345】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2.13-1 ~ 化合物 2.13-240。

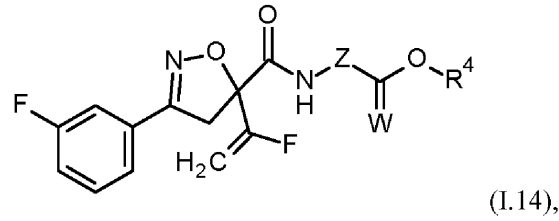
40

【0346】

表 2.14 : 一般式 (I.14)

50

【化38】



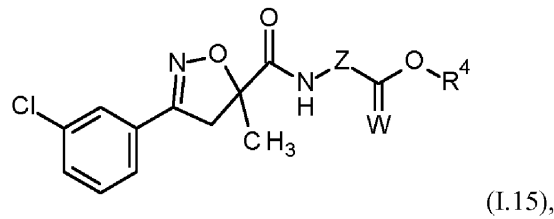
【0347】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2 . 1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2 . 1 4 - 1 ~ 化合物 2 . 1 4 - 2 4 0。

【0348】

表 2 . 1 5 : 一般式 (I . 1 5)

【化39】



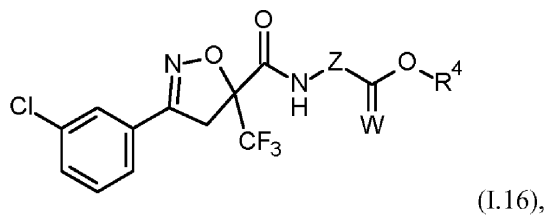
【0349】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2 . 1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2 . 1 5 - 1 ~ 化合物 2 . 1 5 - 2 4 0。

【0350】

表 2 . 1 6 : 一般式 (I . 1 6)

【化40】



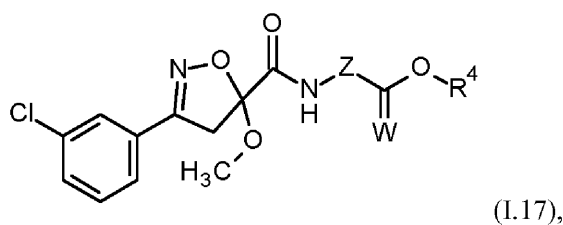
【0351】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2 . 1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2 . 1 6 - 1 ~ 化合物 2 . 1 6 - 2 4 0。

【0352】

表 2 . 1 7 : 一般式 (I . 1 7)

【化41】



10

20

30

40

50

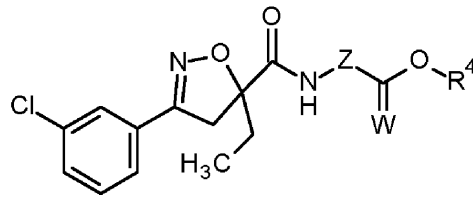
【 0 3 5 3 】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2 . 1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2 . 1 7 - 1 ~ 化合物 2 . 1 7 - 2 4 0。

【 0 3 5 4 】

表 2 . 1 8 : 一般式 (I . 1 8)

【化 4 2 】



(I.18),

10

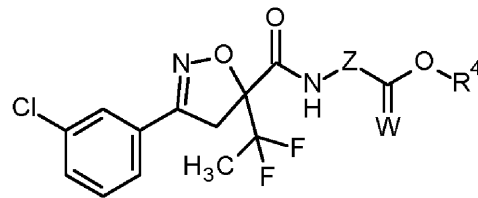
【 0 3 5 5 】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2 . 1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2 . 1 8 - 1 ~ 化合物 2 . 1 8 - 2 4 0。

【 0 3 5 6 】

表 2 . 1 9 : 一般式 (I . 1 9)

【化 4 3 】



(I.19),

20

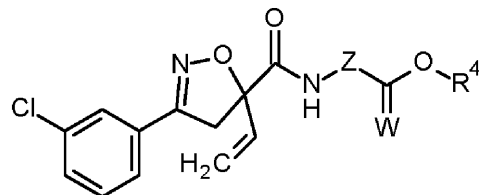
【 0 3 5 7 】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2 . 1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2 . 1 9 - 1 ~ 化合物 2 . 1 9 - 2 4 0。

【 0 3 5 8 】

表 2 . 2 0 : 一般式 (I . 2 0)

【化 4 4 】



(I.20),

40

【 0 3 5 9 】

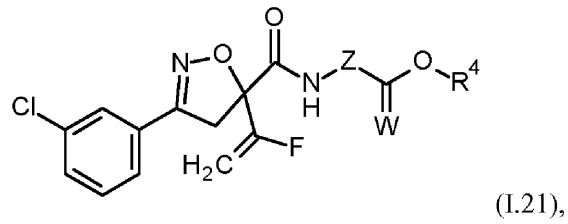
〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2 . 1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2 . 2 0 - 1 ~ 化合物 2 . 2 0 - 2 4 0。

【 0 3 6 0 】

表 2 . 2 1 : 一般式 (I . 2 1)

50

【化 4 5】



【0361】

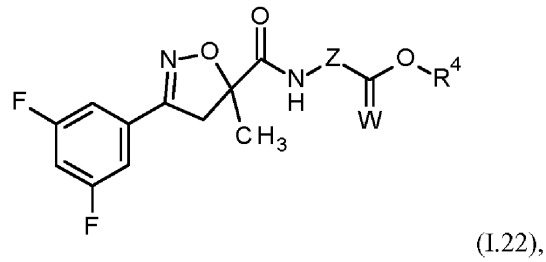
〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.21-1 ~ 化合物 2.21-240。

10

【0362】

表 2.22 : 一般式 (I.22)

【化 4 6】



20

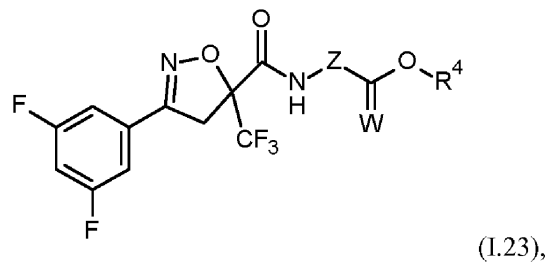
【0363】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.22-1 ~ 化合物 2.22-240。

【0364】

表 2.23 : 一般式 (I.23)

【化 4 7】



30

【0365】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.23-1 ~ 化合物 2.23-240。

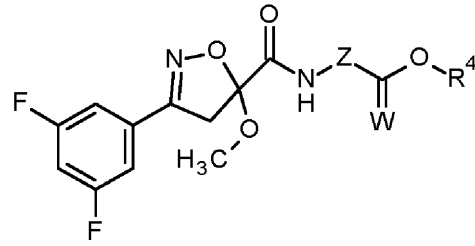
40

【0366】

表 2.24 : 一般式 (I.24)

50

【化 4 8】



(I.24),

10

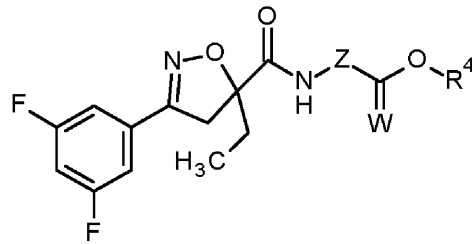
【0367】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2.24-1 ~ 化合物 2.24-240。

【0368】

表 2.25 : 一般式 (I.25)

【化 4 9】



(I.25),

20

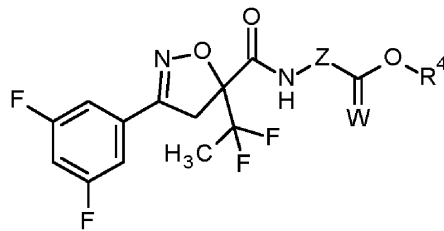
【0369】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2.25-1 ~ 化合物 2.25-240。

【0370】

表 2.26 : 一般式 (I.26)

【化 5 0】



(I.26),

30

【0371】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2.26-1 ~ 化合物 2.26-240。

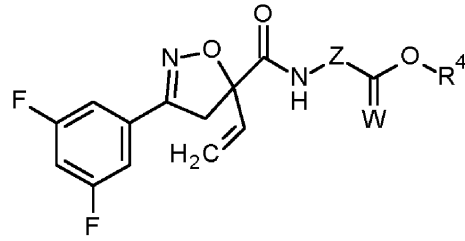
【0372】

表 2.27 : 一般式 (I.27)

40

50

【化51】



(I.27),

10

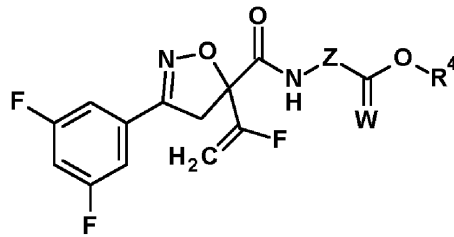
【0373】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.27-1 ~ 化合物 2.27-240。

【0374】

表 2.28 : 一般式 (I.28)

【化52】



(I.28),

20

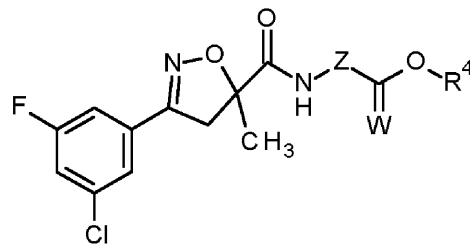
【0375】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.28-1 ~ 化合物 2.28-240。

【0376】

表 2.29 : 一般式 (I.29)

【化53】



(I.29),

30

【0377】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.29-1 ~ 化合物 2.29-240。

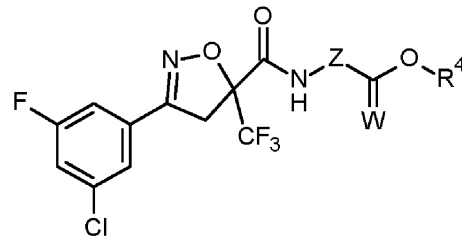
【0378】

表 2.30 : 一般式 (I.30)

40

50

【化54】



(I.30),

10

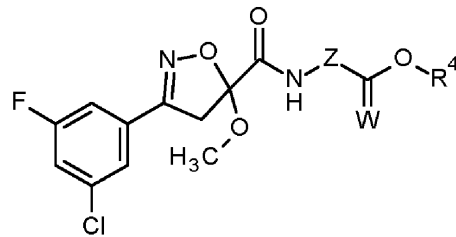
【0379】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴は、表2.1において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物2.30-1～化合物2.30-240。

【0380】

表2.31：一般式(I.31)

【化55】



(I.31),

20

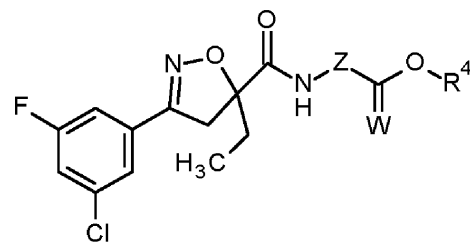
【0381】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴は、表2.1において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物2.31-1～化合物2.31-240。

【0382】

表2.32：一般式(I.32)

【化56】



(I.32),

40

【0383】

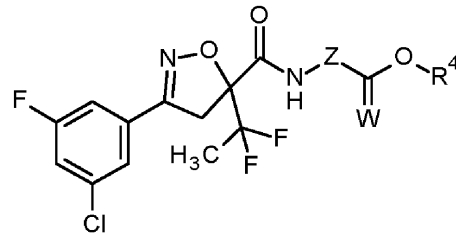
〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴は、表2.1において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物2.32-1～化合物2.32-240。

【0384】

表2.33：一般式(I.33)

50

【化57】



(I.33),

10

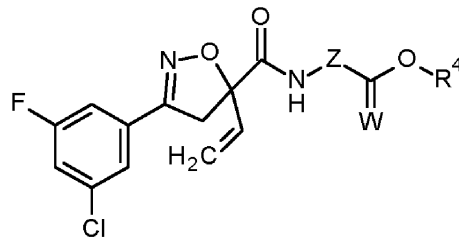
【0385】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.33-1 ~ 化合物 2.33-240。

【0386】

表 2.34 : 一般式 (I.34)

【化58】



(I.34),

20

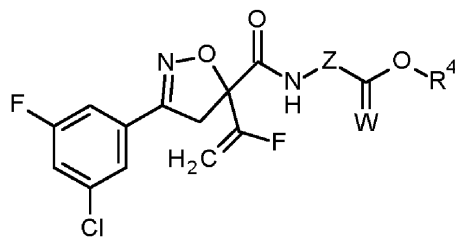
【0387】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.34-1 ~ 化合物 2.34-240。

【0388】

表 2.35 : 一般式 (I.35)

【化59】



(I.35),

40

【0389】

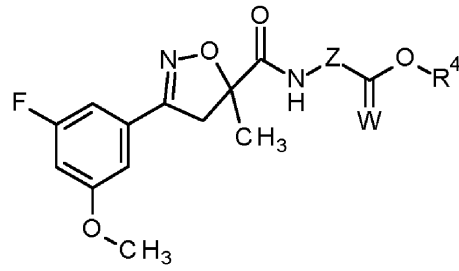
〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.35-1 ~ 化合物 2.35-240。

【0390】

表 2.36 : 一般式 (I.36)

50

【化60】



(I.36),

10

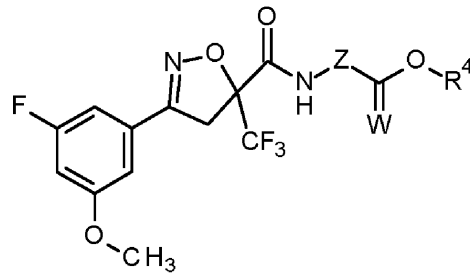
【0391】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2.36-1 ~ 化合物 2.36-240。

【0392】

表 2.37 : 一般式 (I.37)

【化61】



(I.37),

20

【0393】

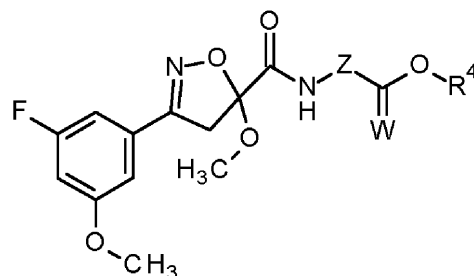
〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2.37-1 ~ 化合物 2.37-240。

30

【0394】

表 2.38 : 一般式 (I.38)

【化62】



(I.38),

40

【0395】

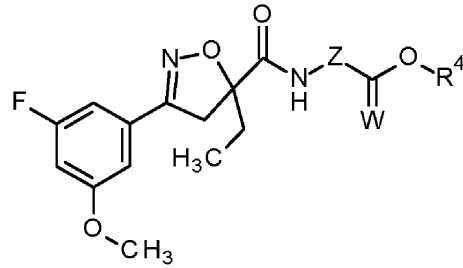
〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2.38-1 ~ 化合物 2.38-240。

【0396】

表 2.39 : 一般式 (I.39)

50

【化63】



(I.39),

10

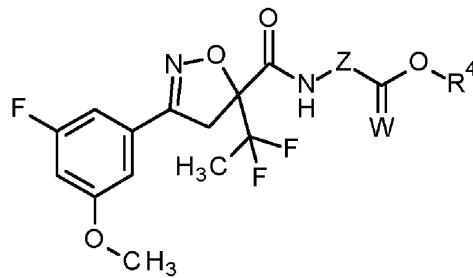
【0397】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2.39-1 ~ 化合物 2.39-240。

【0398】

表 2.40 : 一般式 (I.40)

【化64】



(I.40),

20

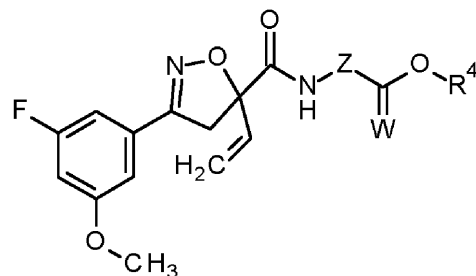
【0399】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2.40-1 ~ 化合物 2.40-240。

【0400】

表 2.41 : 一般式 (I.41)

【化65】



(I.41),

40

【0401】

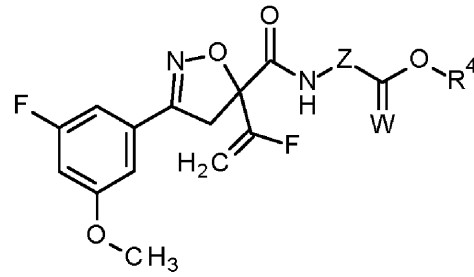
〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2.41-1 ~ 化合物 2.41-240。

【0402】

表 2.42 : 一般式 (I.42)

50

【化 6 6】



(I.42),

10

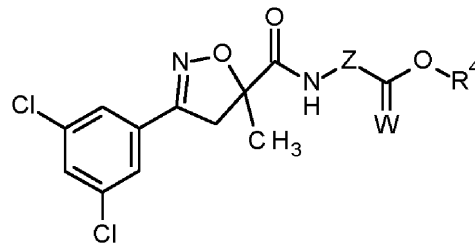
【0403】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.42-1 ~ 化合物 2.42-240。

【0404】

表 2.43 : 一般式 (I.43)

【化 6 7】



(I.43),

20

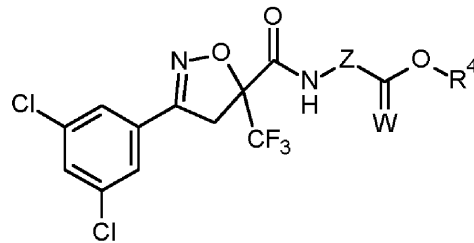
【0405】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.43-1 ~ 化合物 2.43-240。

【0406】

表 2.44 : 一般式 (I.44)

【化 6 8】



(I.44),

40

【0407】

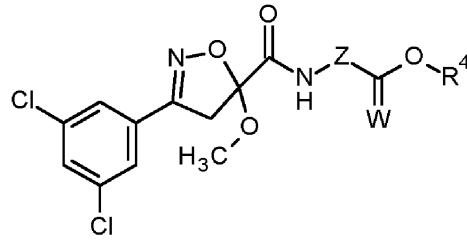
〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.44-1 ~ 化合物 2.44-240。

【0408】

表 2.45 : 一般式 (I.45)

50

【化69】



10

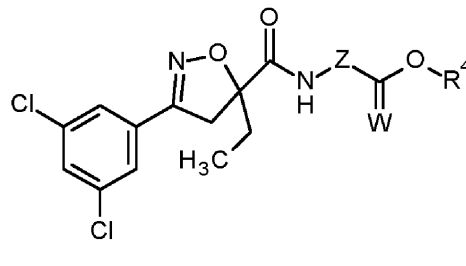
【0409】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2.45-1 ~ 化合物 2.45-240。

【0410】

表 2.46 : 一般式 (I.46)

【化70】



20

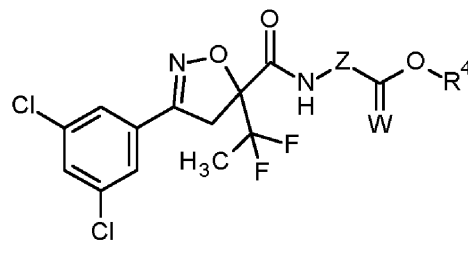
【0411】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2.46-1 ~ 化合物 2.46-240。

【0412】

表 2.47 : 一般式 (I.47)

【化71】



40

【0413】

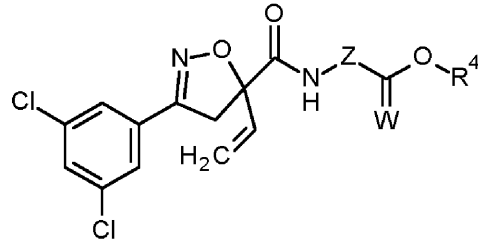
〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2.47 ~ 化合物 2.47-240。

【0414】

表 2.48 : 一般式 (I.48)

50

【化72】



(I.48),

10

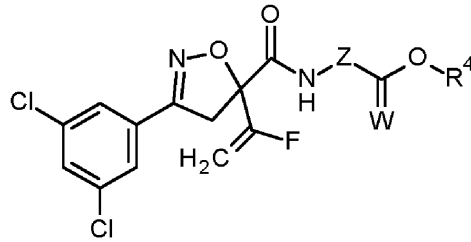
【0415】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.48-1 ~ 化合物 2.48-240。

【0416】

表 2.49 : 一般式 (I.49)

【化73】



(I.49),

20

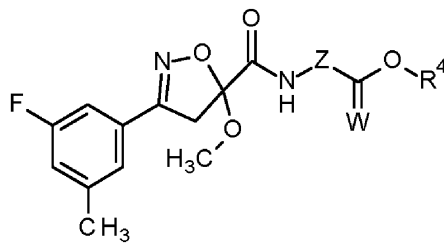
【0417】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.49-1 ~ 化合物 2.49-240。

【0418】

表 2.50 : 一般式 (I.50)

【化74】



(I.50),

40

【0419】

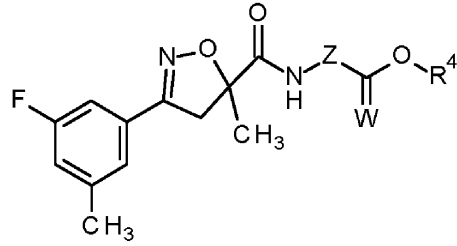
〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2.1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2.50-1 ~ 化合物 2.50-240。

【0420】

表 2.51 : 一般式 (I.51)

50

【化 7 5】



10

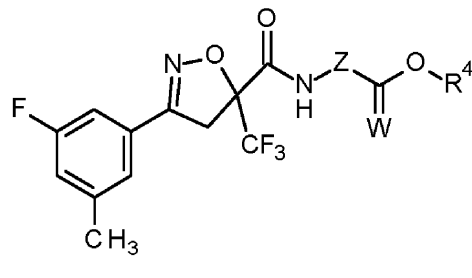
【0 4 2 1】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2 . 1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2 . 5 1 - 1 ~ 化合物 2 . 5 1 - 2 4 0。

【0 4 2 2】

表 2 . 5 2 : 一般式 (I . 5 2)

【化 7 6】



20

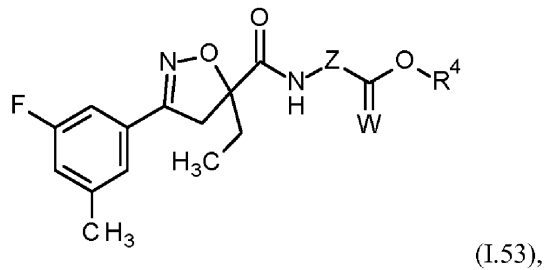
【0 4 2 3】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2 . 1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2 . 5 2 - 1 ~ 化合物 2 . 5 2 - 2 4 0。

【0 4 2 4】

表 2 . 5 3 : 一般式 (I . 5 3)

【化 7 7】



40

【0 4 2 5】

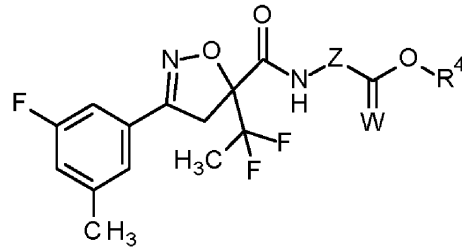
〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2 . 1 において定義されているとおりである〕
 で表される本発明の化合物 2 . 5 3 - 1 ~ 化合物 2 . 5 3 - 2 4 0。

【0 4 2 6】

表 2 . 5 4 : 一般式 (I . 5 4)

50

【化 7 8】



(I.54),

10

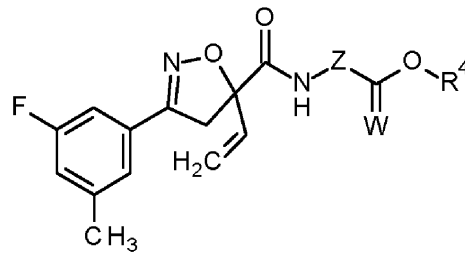
【0 4 2 7】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2 . 1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2 . 5 4 - 1 ~ 化合物 2 . 5 4 - 2 4 0。

【0 4 2 8】

表 2 . 5 5 : 一般式 (I . 5 5)

【化 7 9】



(I.55),

20

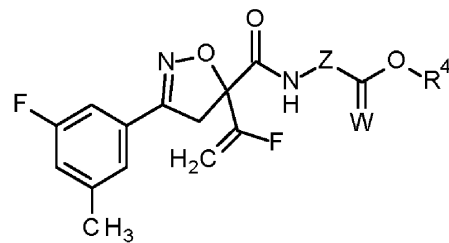
【0 4 2 9】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2 . 1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2 . 5 5 - 1 ~ 化合物 2 . 5 5 - 2 4 0。

【0 4 3 0】

表 2 . 5 6 : 一般式 (I . 5 6)

【化 8 0】



(I.56),

40

【0 4 3 1】

〔式中、Z - (C = W) - O - R⁴ は、表 2 . 1 において定義されているとおりである〕
で表される本発明の化合物 2 . 5 6 - 1 ~ 化合物 2 . 5 6 - 2 4 0。

【0 4 3 2】

B . 製剤実施例

1 . 散粉性製品 (dusting product)

散粉性製品は、10重量部の式 (I) で表される化合物と90重量部の不活性物質としてのタルクを混合させ、及び、その混合物をハンマーミルの中で粉碎することによって、得られる。

【0 4 3 3】

50

2. 分散性粉末 (dispersible powder)

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

【0434】

3. 分散製剤 (dispersion concentrate)

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

【0435】

4. 乳剤

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

【0436】

5. 顆粒水和剤

顆粒水和剤は、

- 75重量部の式(I)で表される化合物、
- 10重量部のリグノスルホン酸カルシウム、
- 5重量部のラウリル硫酸ナトリウム、
- 3重量部のポリビニルアルコール、及び、
- 7重量部のカオリン

を混合させ、その混合物をピンディスクミルの中で摩砕し、並びに、得られた粉末を、流動床の中で造粒液(granulating liquid)としての水を噴霧施用することにより、造粒することによって得られる。

【0437】

顆粒水和剤は、さらにまた、コロイドミルの中で、

- 25重量部の式(I)で表される化合物、
- 5重量部の2,2'-ジナフチルメタン-6,6'-ジスルホン酸ナトリウム、
- 2重量部のオレオイルメチルタウリン酸ナトリウム(sodium oleoylmethyltaurinate)、
- 1重量部のポリビニルアルコール、
- 17重量部の炭酸カルシウム、及び、
- 50重量部の水

を均質化及び前粉碎し、次いで、その混合物をビーズミルの中で摩砕し、並びに、そのようにして得られた懸濁液を噴霧塔の中で単一相ノズル(one-phase nozzle)を用いて噴霧及び乾燥させることによって、得られる。

【0438】

C. 生物学の実施例

試験に関する説明

1. 発生前除草作用及び作物植物との適合性

プラスチック製又は木質繊維製のポット内に単子葉及び双子葉の雑草植物及び作物植物の種子を配置し、土壌で被覆する。次いで、その被覆土壌の表面に、水和剤(WP)の形態に又は乳剤(EC)として製剤された本発明の化合物を、0.5%の添加剤が添加された水性懸濁液又は水性エマルジョンとして、600L/ha(変換)の散布水量で施用する。処理後、ポットを温室内に置き、その被験植物にとって良好な成育条件下に維持する。

10

20

30

40

50

約3週間経過した後、当該調製物の効果について、処理されていない対照と比較して、百分率として視覚的に評価する。例えば、100%の活性 = 植物の枯死、0%の活性 = 対照植物と同様。

【0439】

以下の表では、下記略語が使用されている：

【表4】

望ましくない植物／雑草：

ABUTH:	イチビ (Abutilon theophrasti)	ALOMY:	ノスズメノテッポウ (Alopecurus myosuroides)	10
AMARE:	アオゲイトウ (Amaranthus retroflexus)	AVEFA:	カラスムギ (Avena fatua)	
ECHCG:	イヌビエ (Echinochloa crus-galli)	HORMU:	ムギクサ (Hordeum murinum)	
LOLRI:	ボウムギ (Lolium rigidum)	PHBPU:	マルバアサガオ (Pharbitis purpurea)	20
POLCO:	ソバカズラ (Polygonum convolvulus)	SETVI:	エノコログサ (Setaria viridis)	
STEME:	コハコベ (Stellaria media)	VERPE:	オオイヌノフグリ (Veronica persica)	
VIOTR:	サンシキスミレ (Viola tricolor)			30

【0440】

40

50

【表 5】

表 C1： ALOMY に対する発生前除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	ALOMY
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	100
I-38	80	100
I-45	80	100
I-42	80	100
I-10	80	100
I-44	80	100
I-12	80	100
I-43	80	100
I-41	80	100
I-21	80	100
I-46	80	100
I-09	80	100
I-26	80	100
I-30	80	100
I-28	80	100
I-29	80	90
I-27	80	90
I-06	80	80
I-01	80	100
I-34	80	100
I-32	80	100
I-33	80	100
I-19	80	90
I-23	80	90

10

20

30

【 0 4 4 1 】

40

50

【表 6】

表 C2： AVEVA に対する発生前除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	AVEVA
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	100
I-38	80	90
I-45	80	100
I-42	80	90
I-10	80	100
I-44	80	90
I-12	80	100
I-43	80	100
I-41	80	100
I-21	80	90
I-46	80	80
I-09	80	90
I-26	80	90
I-30	80	80
I-28	80	100
I-29	80	80
I-27	80	90
I-06	80	90
I-01	80	90
I-34	80	80
I-19	80	80
I-23	80	90

10

20

30

【 0 4 4 2 】

40

50

【表 7】

表 C3 : ECHCG に対する発生前除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	ECHCG
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	90
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	90
I-38	80	100
I-45	80	100
I-42	80	100
I-10	80	100
I-44	80	90
I-12	80	90
I-43	80	100
I-41	80	100
I-21	80	100
I-46	80	90
I-09	80	90
I-26	80	90
I-28	80	90
I-06	80	80
I-01	80	80
I-34	80	80

10

20

【 0 4 4 3 】

30

40

50

【表 8】

表 C4： LOLRI に対する発生前除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	LOLRI
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	100
I-38	80	100
I-45	80	100
I-42	80	100
I-10	80	100
I-44	80	100
I-12	80	100
I-43	80	100
I-41	80	100
I-46	80	100
I-30	80	100
I-34	80	100
I-32	80	100
I-39	80	100

10

20

【 0 4 4 4 】

30

40

50

【表 9】

表 C5： SETVI に対する発生前除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	SETVI
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	100
I-38	80	100
I-45	80	100
I-42	80	100
I-10	80	100
I-44	80	100
I-12	80	100
I-43	80	100
I-41	80	100
I-21	80	90
I-46	80	100
I-09	80	80
I-26	80	100
I-30	80	100
I-34	80	90
I-32	80	100
I-33	80	100
I-05	80	90

10

20

30

【 0 4 4 5 】

【表 1 0】

表 C6： ABUTH に対する発生前除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	ABUTH
I-11	80	80
I-10	80	100
I-09	80	100
I-06	80	100
I-08	80	100
I-04	80	100
I-02	80	100
I-14	80	100

40

【 0 4 4 6 】

50

【表 1 1】

表 C7: AMARE に対する発生前除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	AMARE
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	100
I-38	80	100
I-45	80	100
I-42	80	100
I-10	80	90
I-44	80	90
I-12	80	100
I-43	80	90
I-41	80	90
I-21	80	100
I-46	80	90
I-09	80	80
I-26	80	100
I-30	80	80
I-28	80	90
I-29	80	90
I-27	80	90
I-32	80	90
I-23	80	80
I-03	80	80
I-24	80	80
I-07	80	90

10

20

30

【 0 4 4 7 】

40

50

【表 1 2】

表 C8 : PHBPU に対する発生前除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	PHBPU
I-49	80	90
I-11	80	100
I-48	80	90
I-35	80	90
I-36	80	90
I-37	80	90
I-45	80	90
I-42	80	90
I-10	80	80
I-44	80	80
I-41	80	90
I-21	80	80
I-26	80	90
I-28	80	90
I-06	80	80

10

20

【 0 4 4 8 】

30

40

50

【表 1 3】

表 C9： POLCO に対する発生前除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	POLCO
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	100
I-38	80	100
I-45	80	100
I-42	80	100
I-44	80	100
I-12	80	100
I-43	80	100
I-41	80	90
I-10	80	100
I-21	80	90
I-46	80	90
I-09	80	100
I-30	80	90
I-29	80	100
I-27	80	80
I-06	80	100
I-01	80	80
I-34	80	90
I-32	80	90
I-33	80	90
I-19	80	90
I-39	80	80
I-08	80	80
I-47	80	90
I-03	80	80
I-04	80	90
I-05	80	80
I-07	80	80

10

20

30

【 0 4 4 9 】

40

50

【表 1 4】

表 C10： STEME に対する発生前除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	STEME
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	100
I-38	80	100
I-45	80	100
I-42	80	100
I-10	80	100
I-44	80	90
I-12	80	100
I-43	80	100
I-41	80	100
I-21	80	100
I-46	80	100
I-26	80	100
I-30	80	90
I-28	80	100
I-29	80	90
I-27	80	90
I-01	80	90
I-34	80	90
I-32	80	90
I-33	80	100
I-19	80	80
I-25	80	100

10

20

30

【 0 4 5 0 】

40

50

【表 1 5】

表 C11: VIOTR に対する発生前除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	VIOTR
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	100
I-38	80	100
I-45	80	100
I-42	80	100
I-10	80	100
I-44	80	80
I-12	80	100
I-43	80	90
I-27	80	90
I-06	80	80

10

20

【 0 4 5 1】

30

40

50

【表 1 6】

表 C12 : VERPE に対する発生前除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	VERPE
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	100
I-38	80	100
I-45	80	80
I-42	80	90
I-10	80	100
I-44	80	80
I-12	80	100
I-43	80	90
I-21	80	100
I-46	80	80
I-09	80	90
I-26	80	100
I-28	80	90
I-29	80	100
I-27	80	90
I-01	80	80
I-33	80	100
I-19	80	90
I-08	80	90
I-25	80	100
I-24	80	100

10

20

30

【 0 4 5 2】

40

50

【表 17】

表 C13: HORMU に対する発生前除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	HORMU
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	90
I-37	80	100
I-38	80	90
I-45	80	100
I-42	80	100
I-10	80	100
I-44	80	100
I-12	80	100
I-43	80	90
I-41	80	100
I-46	80	100
I-30	80	90
I-33	80	80
I-39	80	100
I-47	80	90

10

20

【0453】

上記結果によって示されているように、本発明による化合物、例えば、化合物 No. I - 21 及び表に記載されている別の化合物 (I - 10、I - 26、I - 09、I - 30、I - 28、I - 29、I - 27、I - 01、I - 06、I - 34、I - 19、I - 11、I - 36、I - 37、I - 38、I - 41、I - 42、I - 43、I - 44、I - 46、I - 49) は、発生前処理に使用された場合、1ヘクタール当たり0.08kg以下の活性物質の施用量で、有害な植物、例えば、イチビ (*Abutilon theophrasti*)、ノスズメノテッポウ (*Alopecurus myosuroides*)、アオゲイトウ (*Amaranthus retroflexus*)、カラスムギ (*Avena fatua*)、イヌビエ (*Echinochloa crus-galli*)、ムギクサ (*Hordeum murinum*)、ボウムギ (*Lolium rigidum*)、マルバアサガオ (*Pharbitis purpurea*)、ソバカズラ (*Polygonum convolvulus*)、エノコログサ (*Setaria viridis*)、コハコベ (*Stellaria media*)、オオイヌノフグリ (*Veronica persica*) 及びサンシキスミレ (*Viola tricolor*) などに対して、極めて良好な活性 (80% ~ 100%の除草作用) を示す。

30

40

【0454】

2. 発生前除草作用及び作物植物との適合性

プラスチック製又は木質繊維製のポット内の砂壤土に单子葉及び双子葉の雑草植物及び作物植物の種子を配置し、土壌で被覆し、温室内で制御された成育条件下で栽培する。播種後2~3週間経過した後、被験植物を1葉期で処理する。当該植物の緑色の部分に、水和剤 (WP) の形態に又は乳剤 (EC) として製剤された本発明の化合物を、0.5%の添加剤が添加された水性懸濁液又は水性エマルジョンとして、600L/ha (変換) の散布水量で散布する。被験植物を温室内で最適な成育条件下に約3週間維持した後、当該調

50

製物の活性について、処理されていない対照と比較して、視覚的に評価する。例えば、100%の活性 = 植物の枯死、0%の活性 = 対照植物と同様。

【 0 4 5 5 】

【表 1 8】

表 C14： ALOMY に対する発生後除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	ALOMY
I-54	320	90
I-10	320	100
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	90
I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	100
I-51	320	100
I-42	320	100
I-36	320	90
I-43	320	100
I-44	320	100
I-45	320	100
I-19	320	90
I-06	320	90
I-41	320	100
I-28	320	90
I-35	320	100
I-01	320	100
I-38	320	90
I-39	320	100
I-47	320	100
I-32	320	90
I-11	320	90
I-12	320	90
I-29	320	90
I-26	320	90
I-33	320	100
I-34	320	100
I-21	320	90
I-49	320	90
I-09	320	90
I-04	320	90
I-30	320	100
I-14	320	100
I-05	320	90
I-03	320	90
I-20	320	90
I-27	320	90
I-40	320	90
I-07	320	90
I-23	320	100

10

20

30

40

50

実施例 番号	葉量 [g/ha]	ALOMY
I-25	320	100
I-13	320	90
I-02	320	80
I-24	320	90
I-18	320	80

10

【 0 4 5 6 】

20

30

40

50

【表 19】

表 C15 : AVEFA に対する発生後除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	AVEFA
I-54	320	90
I-10	320	100
I-56	320	100
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	80
I-55	320	90
I-50	320	100
I-46	320	100
I-51	320	100
I-42	320	100
I-36	320	90
I-43	320	100
I-44	320	100
I-45	320	100
I-19	320	100
I-06	320	90
I-41	320	100
I-28	320	100
I-35	320	100
I-01	320	100
I-38	320	90
I-39	320	100
I-47	320	100
I-32	320	100
I-11	320	100
I-12	320	100
I-37	320	100
I-29	320	90
I-26	320	90
I-33	320	100
I-34	320	100
I-21	320	90
I-49	320	80
I-09	320	90
I-04	320	100
I-30	320	100
I-14	320	100
I-05	320	100
I-03	320	80
I-20	320	90
I-27	320	90
I-07	320	90
I-23	320	100

10

20

30

40

50

実施例 番号	葉量 [g/ha]	AVEFA
I-25	320	100
I-13	320	90
I-08	320	100
I-24	320	90
I-18	320	100
I-17	320	80

10

【 0 4 5 7 】

20

30

40

50

【表 2 0】

表 C16: ECHCG に対する発生後除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	ECHCG
I-54	320	90
I-10	320	100
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	90
I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	100
I-51	320	90
I-42	320	100
I-36	320	90
I-43	320	100
I-44	320	100
I-45	320	100
I-19	320	90
I-06	320	90
I-41	320	100
I-28	320	80
I-35	320	100
I-01	320	90
I-38	320	90
I-39	320	100
I-47	320	100
I-32	320	90
I-11	320	90
I-12	320	90
I-37	320	90
I-29	320	90
I-26	320	90
I-33	320	80
I-34	320	90
I-21	320	80
I-49	320	80
I-09	320	80
I-04	320	90
I-30	320	80
I-14	320	80
I-05	320	90
I-03	320	80
I-20	320	80
I-40	320	80
I-07	320	80
I-23	320	90

10

20

30

40

実施例 番号	薬量 [g/ha]	ECHCG
I-13	320	80
I-02	320	90
I-08	320	90

【表 2 1】

表 C17： LOLRI に対する発生後除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	LOLRI
I-54	320	90
I-10	320	100
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	90
I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	100
I-51	320	90
I-42	320	100
I-36	320	90
I-43	320	100
I-44	320	100
I-45	320	100
I-41	320	100
I-35	320	100
I-38	320	90
I-39	320	100
I-47	320	100
I-32	320	100
I-11	320	100
I-12	320	100
I-37	320	90
I-33	320	100
I-34	320	90
I-49	320	90
I-30	320	100
I-23	320	90
I-24	320	90

10

20

30

【 0 4 5 9 】

40

50

【表 2 2】

表 C18： SETVI に対する発生後除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	SETVI
I-54	320	90
I-10	320	90
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	80
I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	80
I-51	320	90
I-42	320	90
I-36	320	80
I-43	320	80
I-44	320	90
I-45	320	90
I-19	320	80
I-06	320	80
I-41	320	90
I-28	320	80
I-35	320	90
I-01	320	90
I-38	320	100
I-39	320	90
I-47	320	80
I-32	320	90
I-11	320	90
I-12	320	90
I-37	320	80
I-29	320	80
I-26	320	80
I-33	320	90
I-34	320	90
I-21	320	80
I-09	320	80
I-04	320	80
I-30	320	90
I-14	320	80
I-05	320	90
I-03	320	80
I-20	320	80
I-27	320	80
I-40	320	80
I-07	320	80
I-13	320	80

10

20

30

40

実施例 番号	薬量 [g/ha]	SETVI
I-02	320	80
I-08	320	80

【 0 4 6 0 】

50

【表 2 3】

表 C19 : ABUTH に対する発生後除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	ABUTH
I-54	320	90
I-10	320	90
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	80
I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	80
I-51	320	80
I-42	320	80
I-36	320	90
I-43	320	80
I-44	320	80
I-45	320	80
I-19	320	80
I-41	320	80
I-28	320	80
I-35	320	80
I-01	320	80
I-38	320	80
I-39	320	80
I-47	320	80
I-32	320	80
I-11	320	90
I-12	320	90
I-37	320	80
I-29	320	80
I-34	320	80
I-25	320	80

10

20

30

【 0 4 6 1 】

40

50

【表 2 4】

表 C20： AMARE に対する発生後除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	AMARE
I-54	320	80
I-10	320	80
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	80
I-55	320	80
I-50	320	80
I-46	320	80
I-51	320	80
I-42	320	80
I-36	320	90
I-43	320	80
I-44	320	80
I-45	320	80
I-19	320	90
I-06	320	80
I-41	320	100
I-28	320	80
I-35	320	90
I-01	320	80
I-38	320	100
I-39	320	80
I-32	320	80
I-11	320	90
I-12	320	90
I-37	320	80
I-26	320	80
I-33	320	90
I-34	320	80
I-21	320	100
I-20	320	80
I-40	320	80
I-23	320	80

10

20

30

【 0 4 6 2 】

40

50

【表 2 5】

表 C21： PHBPU に対する発生後除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	PHBPU	
I-54	320	90	
I-10	320	90	
I-56	320	90	
I-53	320	90	
I-52	320	90	
I-48	320	80	10
I-55	320	90	
I-50	320	90	
I-46	320	90	
I-51	320	90	
I-42	320	90	
I-36	320	80	
I-43	320	90	
I-44	320	90	
I-45	320	90	
I-19	320	80	
I-06	320	90	
I-41	320	90	20
I-28	320	80	
I-35	320	90	
I-01	320	90	
I-38	320	90	
I-39	320	90	
I-47	320	90	
I-32	320	90	
I-11	320	90	
I-12	320	90	
I-37	320	90	
I-29	320	80	
I-26	320	80	
I-33	320	90	30
I-34	320	90	
I-21	320	80	
I-49	320	80	
I-09	320	90	
I-04	320	90	
I-30	320	90	
I-14	320	80	
I-05	320	90	
I-03	320	90	
I-20	320	80	
I-27	320	80	
I-40	320	90	40

実施例 番号	薬量 [g/ha]	PHBU
I-07	320	90
I-23	320	90
I-25	320	80
I-13	320	90
I-02	320	90
I-08	320	90
I-24	320	80

10

【 0 4 6 3 】

20

30

40

50

【表 2 6】

表 C22 : POLCO に対する発生後除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	POLCO
I-54	320	90
I-10	320	80
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	80
I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	80
I-51	320	90
I-42	320	80
I-36	320	80
I-43	320	80
I-44	320	80
I-45	320	80
I-19	320	80
I-06	320	80
I-41	320	90
I-28	320	80
I-01	320	80
I-39	320	80
I-47	320	80
I-32	320	80
I-11	320	90
I-12	320	90
I-29	320	80
I-33	320	80
I-49	320	80
I-09	320	80
I-04	320	80
I-30	320	80
I-14	320	90
I-05	320	90
I-03	320	80
I-20	320	80
I-27	320	80
I-40	320	80
I-07	320	80
I-23	320	90
I-25	320	90
I-13	320	80
I-02	320	90
I-08	320	80

10

20

30

40

実施例 番号	薬量 [g/ha]	POLCO
I-24	320	90
I-17	320	90
I-22	320	90

【表 2 7】

表 C23： STEME に対する発生後除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	STEME
I-54	320	90
I-10	320	90
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	90
I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	90
I-51	320	90
I-42	320	90
I-36	320	90
I-43	320	100
I-44	320	90
I-45	320	90
I-19	320	90
I-06	320	80
I-41	320	90
I-28	320	80
I-35	320	90
I-01	320	90
I-38	320	90
I-39	320	90
I-47	320	90
I-32	320	90
I-11	320	90
I-12	320	90
I-37	320	90
I-29	320	80
I-26	320	90
I-33	320	90
I-34	320	90
I-21	320	80
I-49	320	90
I-09	320	90
I-04	320	90
I-30	320	90
I-14	320	90
I-05	320	90
I-03	320	90
I-20	320	80
I-27	320	80
I-40	320	80

10

20

30

40

実施例 番号	薬量 [g/ha]	STEME
I-07	320	90
I-23	320	90
I-25	320	90

【表 2 8】

表 C24: VIOTR に対する発生後除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	VIOTR
I-54	320	90
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	80
I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	90
I-51	320	90
I-42	320	90
I-36	320	90
I-43	320	90
I-44	320	90
I-45	320	90
I-19	320	80
I-06	320	90
I-41	320	80
I-28	320	80
I-35	320	80
I-01	320	90
I-38	320	80
I-39	320	80
I-47	320	80
I-11	320	90
I-12	320	100
I-37	320	80
I-29	320	80
I-26	320	80
I-21	320	80
I-49	320	80
I-09	320	80
I-04	320	80
I-10	320	80
I-27	320	80
I-02	320	80
I-08	320	80

10

20

30

40

【 0 4 6 6 】

50

【表 2 9】

表 C25 : VERPE に対する発生後除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	VERPE
I-54	320	90
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	80
I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	80
I-51	320	90
I-42	320	80
I-36	320	90
I-43	320	90
I-44	320	80
I-45	320	80
I-19	320	80
I-06	320	80
I-41	320	80
I-28	320	90
I-35	320	80
I-01	320	80
I-38	320	80
I-39	320	80
I-47	320	80
I-32	320	80
I-37	320	80
I-29	320	90
I-26	320	90
I-33	320	80
I-34	320	80
I-21	320	100
I-49	320	80
I-09	320	80
I-04	320	80
I-30	320	80
I-14	320	80
I-10	320	80
I-05	320	80
I-03	320	80
I-20	320	90
I-27	320	80
I-40	320	80
I-07	320	80
I-25	320	80

10

20

30

40

実施例 番号	薬量 [g/ha]	VERPE
I-13	320	80
I-02	320	80
I-08	320	80
I-18	320	80

50

【 0 4 6 7 】

【 表 3 0 】

表 C26 : HORMU に対する発生後除草活性 (%)

実施例 番号	薬量 [g/ha]	HORMU
I-54	320	90
I-10	320	100
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	90
I-55	320	100
I-50	320	100
I-46	320	100
I-51	320	90
I-42	320	100
I-36	320	90
I-43	320	100
I-44	320	100
I-45	320	100
I-41	320	100
I-35	320	100
I-38	320	90
I-39	320	100
I-47	320	100
I-32	320	90
I-11	320	100
I-12	320	90
I-37	320	80
I-33	320	90
I-34	320	100
I-30	320	100
I-40	320	90
I-23	320	100
I-24	320	90

10

20

30

【 0 4 6 8 】

上記結果によって示されているように、本発明による化合物、例えば、化合物 No. I - 35 及び表に記載されている別の化合物 (I - 28、I - 38、I - 01、I - 19、I - 36、I - 29、I - 32、I - 11、I - 12、I - 37、I - 06、I - 09、I - 33、I - 34、I - 13、I - 04、I - 26、I - 21、I - 30、I - 05、I - 03、I - 20、I - 27、I - 14、I - 10、I - 23、I - 07、I - 25、I - 02、I - 08、I - 24、I - 41、I - 42、I - 43、I - 44、I - 46、I - 49、I - 54、I - 55、I - 56) は、発生後処理に使用された場合、1ヘクタール当たり 0.32 kg 以下の活性物質の施用量で、有害な植物、例えば、イチビ (*Abutilon theophrasti*)、ノスズメノテッポウ (*Alopecurus myosuroides*)、アオゲイトウ (*Amaranthus retroflexus*)、カラスムギ (*Avena fatua*)、イヌビエ (*Echinochloa crus-galli*)、ムギクサ (*Hordeum murinum*)、ボウムギ (*Lolium rigidum*)、マルバアサガオ (*Pharbitis purpurea*)、ソバカズラ (*Polygonum convolvulus*)、エノコログサ (*Seta*

40

50

ria viridis)、コハコベ (*Stellaria media*)、オオイヌノフグリ (*Veronica persica*)及びサンシキスミレ (*Viola tricolor*)などに対して、極めて良好な除草活性 (80% ~ 100% の除草作用) を示す。

10

20

30

40

50

フロントページの続き

- (74)代理人 100124855
弁理士 坪倉 道明
- (74)代理人 100129713
弁理士 重森 一輝
- (74)代理人 100137213
弁理士 安藤 健司
- (74)代理人 100143823
弁理士 市川 英彦
- (74)代理人 100151448
弁理士 青木 孝博
- (74)代理人 100183519
弁理士 櫻田 芳恵
- (74)代理人 100196483
弁理士 川崎 洋祐
- (74)代理人 100203035
弁理士 五味淵 琢也
- (74)代理人 100185959
弁理士 今藤 敏和
- (74)代理人 100160749
弁理士 飯野 陽一
- (74)代理人 100160255
弁理士 市川 祐輔
- (74)代理人 100202267
弁理士 森山 正浩
- (74)代理人 100146318
弁理士 岩瀬 吉和
- (74)代理人 100127812
弁理士 城山 康文
- (72)発明者 ペーターズ, オラフ
ドイツ国、9 9 8 9 1・タバルツ、ランゲンハイナー・シュトラーセ・8
- (72)発明者 ハーフ, クラウス・ベルナルト
ドイツ国、6 5 7 7 9・ケルクハイム、ロベルト - コッホ - シュトラーセ・9
- (72)発明者 リンデル, ステファン・ダーヴィト
ドイツ国、6 5 8 1 7・エップシュタイン、アム・ヒルテングラーベン・1 1
- (72)発明者 ボージャック, ギード
ドイツ国、6 5 2 0 7・ヴィースバーデン - ナウロード、ホーフエッカーシュトラーセ・2 3
- (72)発明者 ロウ, キャスリーン・ローゼ
ドイツ国、6 5 8 1 2・バード・ゾーデン、ヴィーゼンヴェーク・8
- (72)発明者 マチェッティラ, アヌ・ピームアイア
ドイツ国、6 0 3 2 6・フランクフルト・アム・メイン、ニーダーハウゼナー・シュトラーセ・4
7
- (72)発明者 ディートリヒ, ハンスユルグ
ドイツ国、6 5 8 3 5・リーダーバッハ・アム・タウヌス、ボニファツィウスシュトラーセ・1 ベ
ー
- (72)発明者 ガツヴァイラー, エルマー
ドイツ国、6 1 2 3 1・パート・ナウハイム、アム・ナウハイマー・バッハ・2 2
- (72)発明者 ロージンガー, クリストファー・ヒュー
ドイツ国、6 5 7 1 9・ホーフハイム、アム・ホーフフェルト・3 3
- 審査官 阿久津 江梨子

-
- (56)参考文献 特表2014-515015(JP,A)
特表2015-530398(JP,A)
- (58)調査した分野 (Int.Cl., DB名)
- C07D 413/12
 - A01N 43/80
 - A01P 13/00
 - A01G 7/06
 - A01M 21/04
 - CAplus/REGISTRY(STN)