

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第4592183号
(P4592183)

(45) 発行日 平成22年12月1日(2010.12.1)

(24) 登録日 平成22年9月24日(2010.9.24)

(51) Int.Cl.		F I	
CO7D 231/12	(2006.01)	CO7D 231/12	CSPZ
CO7D 231/16	(2006.01)	CO7D 231/16	
AO1N 43/56	(2006.01)	AO1N 43/56	C
AO1P 13/00	(2006.01)	AO1P 13/00	

請求項の数 4 (全 59 頁)

<p>(21) 出願番号 特願2000-507656 (P2000-507656)</p> <p>(86) (22) 出願日 平成10年8月5日(1998.8.5)</p> <p>(65) 公表番号 特表2001-514171 (P2001-514171A)</p> <p>(43) 公表日 平成13年9月11日(2001.9.11)</p> <p>(86) 国際出願番号 PCT/EP1998/004634</p> <p>(87) 国際公開番号 W01999/010327</p> <p>(87) 国際公開日 平成11年3月4日(1999.3.4)</p> <p>審査請求日 平成17年7月21日(2005.7.21)</p> <p>(31) 優先権主張番号 197 34 164.0</p> <p>(32) 優先日 平成9年8月7日(1997.8.7)</p> <p>(33) 優先権主張国 ドイツ(DE)</p> <p>前置審査</p>	<p>(73) 特許権者 508020155 ビーエーエスエフ ソシエタス・ヨーロッパ BASF SE ドイツ連邦共和国 ルートヴィヒスハーフェン (番地なし) D-67056 Ludwigshafen, Germany</p> <p>(74) 代理人 100100354 弁理士 江藤 聡明</p> <p>(72) 発明者 エンゲル, シュテファン ドイツ、D-55286、ヴェルシュタット、ケラーシュトラッセ、8</p>
---	--

最終頁に続く

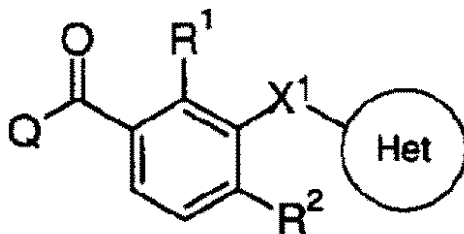
(54) 【発明の名称】 2-ベンゾイルシクロヘキサン-1, 3-ジオン

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I a

【化1】



Ia

[但し、R¹が、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシC₁~C₆アルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆アルキニル、-OR³又は-S(O)_nR³を表し、

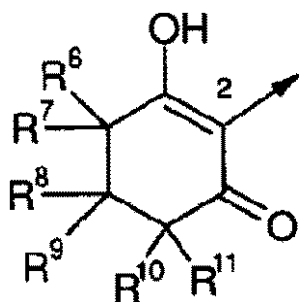
R²が、水素、又はハロゲン以外のR¹で述べた基の1個を表し、

R³が水素、C₁~C₆アルキルを表し、

nが1又は2を表し、

Qが2位に結合する式 I I

【化2】



II

10

[但し、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 及び R^{11} が、それぞれ水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、上記 $C R^8 R^9$ 単位が、 $C=O$ で置き換わっていても良い]

で表されるシクロヘキサン - 1, 3 - ジオン環を表し、

X^1 が酸素により中断された、直鎖又は分岐の $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖、 $C_2 \sim C_6$ アルケニレン鎖、または $C_2 \sim C_6$ アルキニレン鎖、或いは $-OCH_2-$ 、 $-CH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH=CHCH_2O-$ 又は $-C \quad CCH_2O-$ を表し、

H e t が、

窒素、酸素及び硫黄から選択される1～3個のヘテロ原子を有する、3～6員の部分飽和若しくは完全飽和ヘテロシクリル基、又は

20

下記の3個の群：窒素、酸素と少なくとも1個の窒素との組み合わせ、又は硫黄と少なくとも1個の窒素との組み合わせから選択されるヘテロ原子を3個まで有する、3～6員のヘテロ芳香族基、を表し、且つ上述のヘテロシクリル基又はヘテロ芳香族基は、部分的に又は完全にハロゲン化されていても、及び/又は R^5 で置換されていても良く、

R^5 が水素、ヒドロキシル、メルカプト、アミノ、シアノ、ニトロ、ホルミル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシを表し、且つ上記アルキル基は、それぞれ1個以上の下記の基：

30

シアノ、ホルミル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシで置換されていても良い]

で表される2 - ベンゾイルシクロヘキサン - 1, 3 - ジオン又はその農業上有用な塩。

【請求項2】

X^1 が酸素で遮断されている $C_2 \sim C_3$ アルキレン鎖、 $C_2 \sim C_3$ アルケニレン鎖又は $C_2 \sim C_3$ アルキニレン鎖、或いは $-OCH_2-$ または $-CH_2O-$ を表す、請求項1に記載の式I aで表される2 - ベンゾイルシクロヘキサン - 1, 3 - ジオン。

【請求項3】

40

H e t が、

窒素、酸素及び硫黄から選択される1～3個のヘテロ原子を有する、5員若しくは6員の部分飽和若しくは完全飽和ヘテロシクリル基、又は

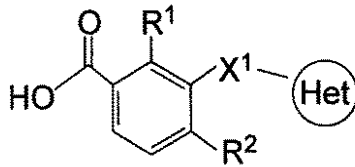
下記の3個の群：窒素、酸素と少なくとも1個の窒素との組み合わせ、又は硫黄と少なくとも1個の窒素との組み合わせから選択されるヘテロ原子を3個まで有する、5員若しくは6員のヘテロ芳香族基、を表す請求項1又は2に記載の式I aで表される2 - ベンゾイルシクロヘキサン - 1, 3 - ジオン。

【請求項4】

請求項1～3のいずれかに記載の式I aで表される2 - ベンゾイルシクロヘキサン - 1, 3 - ジオンの製造方法であって、置換又は非置換のシクロヘキサン - 1, 3 - ジオンQ

50

を、カルボン酸 III b'
【化 3】



III b'

10

[但し、置換基 R^1 、 R^2 、 X^1 及びHetが、それぞれ請求項1と同義である]
でアシル化し、適宜触媒の存在下に、アシル化生成物を転位させて化合物 Ia を得ることを特徴とする製造方法。

【発明の詳細な説明】

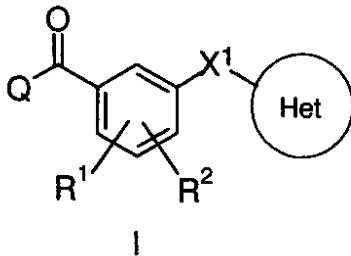
【0001】

本発明は、式 I

【0002】

20

【化 5】



I

[但し、 R^1 及び R^2 が、それぞれ水素、メルカプト、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-OR^3$ 、 $-OCOR^3$ 、 $-OSO_2R^3$ 、 $-S(O)_nR^3$ 、 $-SO_2OR^3$ 、 $-SO_2N(R^3)_2$ 、 $-NR^3SO_2R^3$ 又は $-NR^3COR^3$ を表し；

30

R^3 が水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、フェニル又はフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、且つ上述のアルキル基は部分的に又は完全にハロゲン化されていても、及び/又は1～3個の下記の基：ヒドロキシル、メルカプト、アミノ、シアノ、 R^3 、 $-OR^3$ 、 $-SR^3$ 、 $-N(R^3)_2$ 、 $=NOR^3$ 、 $-OCOR^3$ 、 $-SCOR^3$ 、 $-NR^3COR^3$ 、 $-CO_2R^3$ 、 $-COSR^3$ 、 $-CON(R^3)_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキルイミノオキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホ

40

ニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルオキシ、フェニル、ベンジル、ヘテロアリール、フェノキシ、ベンジルオキシ及びヘテロアリールオキシ（最後の8個の基は置換されていても良い）を有していても良く；

n が0、1又は2を表し；

Qが、2位で結合する、置換基を有していても良いシクロヘキサン-1,3-ジオン環を表し；

X^1 が直鎖又は分岐 $C_1 \sim C_6$ アルキレン鎖、 $C_2 \sim C_6$ アルケニレン鎖又は $C_2 \sim C_6$ アルキニレン鎖{これら鎖は、酸素又は硫黄から選択されるヘテロ原子により遮断されている}を表し、且つ上述のアルキル、アルケニル又はアルキニル基は、部分的にハロゲン化されていても、及び/又は1～3個の下記の基： $-OR^4$ 、 $-OCOR^4$ 、 $-OCONHR^4$ 又

50

は - O S O₂ R⁴ から選択される基を有していても良く ;

R⁴ が水素、C₁ ~ C₆ アルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₂ ~ C₆ アルキニル、フェニル又はフェニル C₁ ~ C₆ アルキルを表し、且つ上述のアルキル、アルケニル又はアルキニル基は部分的に又は完全にハロゲン化されていても、及びノ又は1個以上の下記の基 : ヒドロキシル、メルカプト、アミノ、シアノ、ニトロ、ホルミル、C₁ ~ C₄ アルキルアミノ、C₁ ~ C₄ ジアルキルアミノ、C₁ ~ C₄ アルコキシカルボニル、C₁ ~ C₄ アルキルカルボニル、C₁ ~ C₄ アルキルカルボニルオキシ、C₁ ~ C₄ アルキル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、C₁ ~ C₄ アルキルチオ、C₁ ~ C₄ ハロアルキルチオ、C₁ ~ C₄ アルコキシ、C₁ ~ C₄ ハロアルコキシから選択される基で置換されていても良く ;

H e t が、3 ~ 6 員の部分飽和若しくは完全飽和ヘテロシクリル基、又は3 ~ 6 員のヘテロ芳香族基 { これら基は、下記の3個の群 : 窒素、酸素と少なくとも1個の窒素との組み合わせ、又は硫黄と少なくとも1個の窒素との組み合わせから選択されるヘテロ原子を3個まで有する } を表し、且つ上述のヘテロシクリル基又はヘテロ芳香族基は、部分的に又は完全にハロゲン化されていても、及びノ又はR⁵ で置換されていても良く ;

R⁵ が水素、ヒドロキシル、メルカプト、アミノ、シアノ、ニトロ、ホルミル、C₁ ~ C₄ アルキルアミノ、C₁ ~ C₄ ジアルキルアミノ、C₁ ~ C₄ アルコキシカルボニル、C₁ ~ C₄ アルキルカルボニル、C₁ ~ C₄ アルキルカルボニルオキシ、C₁ ~ C₄ アルキル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、C₁ ~ C₄ アルキルチオ、C₁ ~ C₄ ハロアルキルチオ、C₁ ~ C₄ アルコキシ、C₁ ~ C₄ ハロアルコキシを表し、且つ上記アルキル基は、それぞれ1個以上の下記の基 : シアノ、ホルミル、C₁ ~ C₄ アルキルアミノ、C₁ ~ C₄ ジアルキルアミノ、C₁ ~ C₄ アルコキシカルボニル、C₁ ~ C₄ アルキルカルボニル、C₁ ~ C₄ アルキルカルボニルオキシ、C₁ ~ C₄ アルキル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、C₁ ~ C₄ アルキルチオ、C₁ ~ C₄ ハロアルキルチオ、C₁ ~ C₄ アルコキシ、C₁ ~ C₄ ハロアルコキシで置換されていても良い]

で表される 2 - ベンゾイルシクロヘキサン - 1 , 3 - ジオン又はその農業上有用な塩に関する。

【 0 0 0 3 】

さらに本発明は、式 I の化合物を製造する方法及びそのための中間体、化合物 I を含む組成物、式 I の化合物の使用、並びに有害植物防除用としての化合物 I を含む組成物に関する。

【 0 0 0 4 】

2 - ベンゾイルシクロヘキサン - 1 , 3 - ジオンは、文献、例えば E P - A 2 7 8 7 4 2 、 E P - A 2 9 8 6 8 0 、 E P - A 3 2 0 8 6 4 及び W O 9 6 / 1 4 2 8 5 に開示されている。

【 0 0 0 5 】

しかしながら、従来技術の化合物が示す除草特性及びその栽培植物の安全性は、完全に満足できるものではない。

【 0 0 0 6 】

本発明の目的は、新規な、特に除草作用において、特性が改良された化合物を提供することにある。

【 0 0 0 7 】

本発明者等は、この目的が式 I の 2 - ベンゾイルシクロヘキサン - 1 , 3 - ジオン及びその除草作用により達成されることを見出した。

【 0 0 0 8 】

さらに本発明者等は、化合物 I を含み極めて良好な除草作用のある除草剤組成物を見出した。さらに、本発明者等は、これら組成物を製造する方法及びこの化合物 I を用いて望ましくない植生を制御する方法を見出した。

【 0 0 0 9 】

本発明は、さらに式 I で表される化合物の立体異性体を提供することにある。この異性体には、純粋な立体異性体のみならず、その混合物も含まれている。

【 0 0 1 0 】

10

20

30

40

50

置換形式により、式 I の化合物は 1 個以上のキラル中心を有することができ、この場合、エナンチオマー又はジアステレオマー混合物として存在する。本発明は、純粋なエナンチオマー又はジアステレオマーのみならず、これらの混合物に関するものでもある。

【0011】

式 I の化合物は、その農業上有用な塩の形態で存在することもでき、塩の種類は一般に重要でない。一般に、これらのカチオンの塩又はこれら酸の酸付加塩が適当であり、そのカチオン又はアニオンは、化合物 I の除草作用に悪影響を与えない。

【0012】

好適なカチオンは、特にアルカリ金属、好ましくはリチウム、ナトリウム及びカリウムのイオン、アルカリ土類金属、好ましくはカルシウム及びマグネシウムのイオン、並びに遷移金属、好ましくはマンガン、銅、亜鉛及び鉄のイオンであり、さらにまたアンモニウム塩（必要により、1～4個の水素原子は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又はヒドロキシ $C_1 \sim C_4$ アルキル及び/又は1個のフェニル又はベンジルで置き換わって良い）、好ましくはジイソプロピルアンモニウム、テトラメチルアンモニウム、テトラブチルアンモニウム、トリメチルベンジルアンモニウムであり、さらにホスホニウムイオン、スルホニウムイオン（好ましくは、トリ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）スルホニウム）及びスルホキソニウムイオン（好ましくはトリ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）スルホキソニウム）である。

【0013】

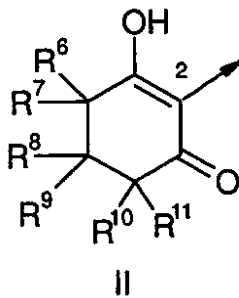
有用な酸付加塩のアニオンは、主に塩化物、臭化物、フッ化物、硫酸水素塩、硫酸塩、磷酸二水素塩、磷酸水素塩、硝酸塩、炭酸水素塩、炭酸塩、ヘキサフルオロ珪酸塩、ヘキサフルオロリン酸塩、安息香酸塩であり、またさらに $C_1 \sim C_4$ アルカン酸のアニオン、好ましくはホルマート、アセタート、プロピオナート及びブチラートである。

【0014】

Qは2位で結合する式 I I

【0015】

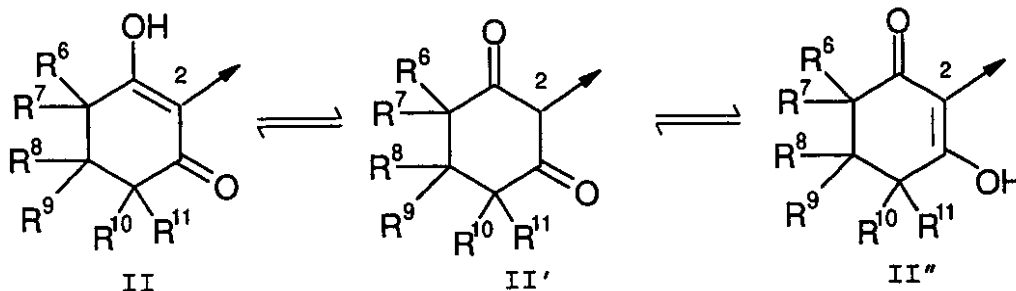
【化6】



で表され、さらに互変異性体 I I' 及び I I''

【0016】

【化7】



も表すシクロヘキサン - 1, 3 - ジオン環である場合の、本発明の式 I で表される化合物が特に重要である：

[但し、 R^6 、 R^7 、 R^9 及び R^{11} が、それぞれ水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し；

R^8 が水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル{最後の2個の基は1~3個の下記の基：ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシから選択される置換基を有していても良い}を表し、或いは

テトラヒドロピラン - 2 - イル、テトラヒドロピラン - 3 - イル、テトラヒドロピラン - 4 - イル、テトラヒドロチオピラン - 2 - イル、テトラヒドロチオピラン - 3 - イル、テトラヒドロチオピラン - 4 - イル、1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル、1, 3 - ジオキサン - 2 - イル、1, 3 - オキサチオラン - 2 - イル、1, 3 - オキサチアン - 2 - イル、1, 3 - ジチオラン - 2 - イル又は1, 3 - ジチアン - 2 - イル{最後の6個の基は1~3個の $C_1 \sim C_4$ アルキル基で置換されていても良い}を表し；

R^{10} が水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表し、又は

R^8 と R^{11} が合体して、結合又は3~6員の炭素環を形成し；又は上記 $C R^8 R^9$ 単位が、 $C = O$ で置き換わっていても良い}。

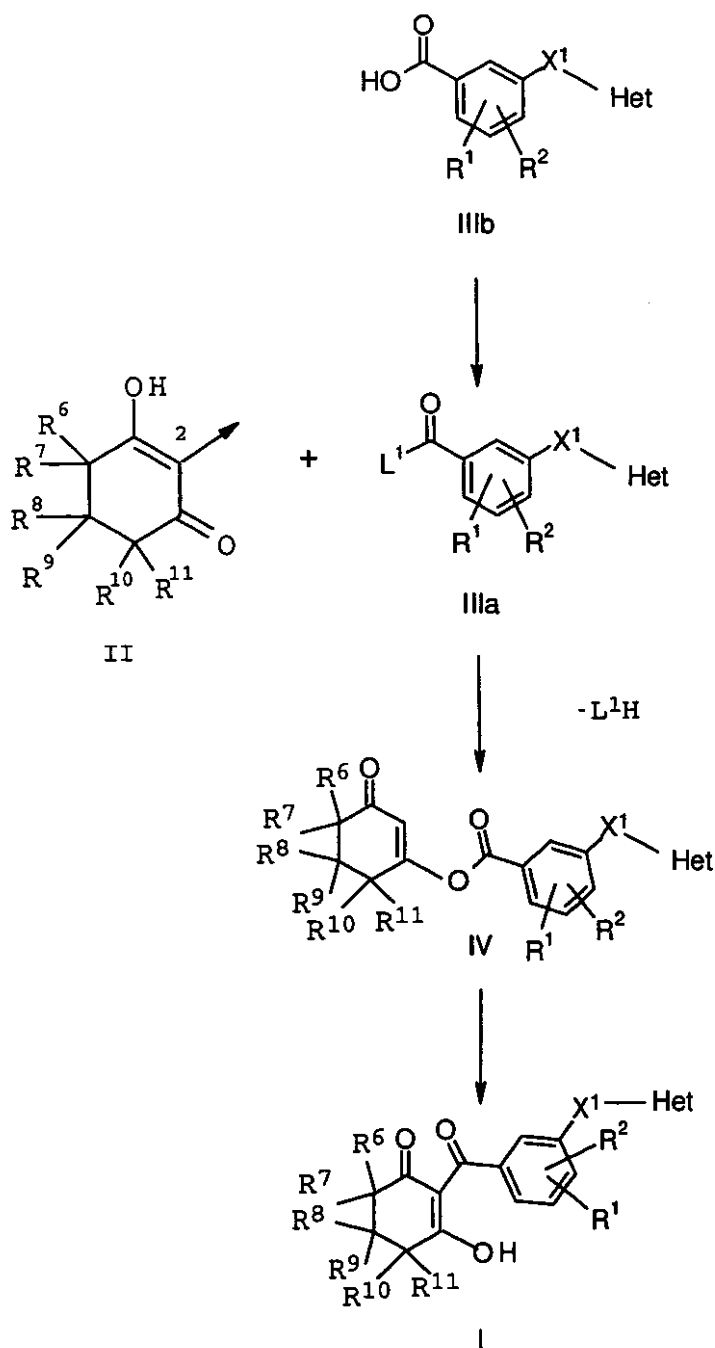
【0017】

方法A：

式IIのシクロヘキサン - 1, 3 - ジオンを、好ましくは系内で活性化される活性化カルボン酸III a又はカルボン酸III bと反応させ、アシル化生成物IVを得、次いで本発明の式Iの化合物に転位させる反応。

【0018】

【化8】



10

20

30

L¹は求核置換可能な脱離基であり、例えばハロゲン（例えば、臭素、塩素）、ヘテロアリール（例えば、イミダゾリル、ピリジル）、又はカルボキシラート（例えば、酢酸、トリフルオロ酢酸）等が挙げられる。

【0019】

活性化カルボン酸を、ハロゲン化アシルの場合のように直接使用することができ、或いは系内で、例えばジシクロヘキシルカルボジイミド、トリフェニルホスフィン/アゾジカルボン酸エステル、2-ピリジンジスルフィド/トリフェニルホスフィン、カルボニルジイミダゾール等を用いて発生させることができる。

【0020】

塩基の存在下にアシル化反応を行うことが有利であろう。出発材料及び補助塩基を、等モル量で使用することが有利である。特定の条件では、IIに対して僅かに過剰の、例えば1.2~1.5モル等量の補助塩基が有利であろう。

【0021】

好適な補助塩基は、第三級アルキルアミン、ピリジン又はアルカリ金属炭酸塩である。使

40

50

用することができる溶剤の例としては、塩素化炭化水素（例えば、塩化メチレン、1,2-ジクロロエタン）、芳香族炭化水素（例えば、トルエン、キシレン、クロロベンゼン）、エーテル（例えば、ジエチルエーテル、メチル tert-ブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン）、非プロトン性極性溶剤（例えば、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド）、又はエステル（例えば、酢酸エチル）、或いはこれらの混合物が挙げられる。

【0022】

ハロゲン化アシルを、活性化カルボン酸成分として使用した場合、この反応材料を添加した際に反応混合物を0~10に冷却することが有利である。次いで、混合物を20~100、好ましくは25~50で、反応が完結するまで攪拌する。後処理は、慣用法で行われ、例えば反応混合物を水に注ぎ、所望の生成物を抽出する。この目的に特に好適な溶剤は、塩化メチレン、ジエチルエーテル及び酢酸エチルである。有機層を乾燥し、溶剤を除去した後、式IVの粗エノールエステルが、好ましくはクロマトグラフィー処理することにより精製される。或いは、転位反応を行うために、式IVの粗エノールエステルを、さらに精製することなく用いることも可能である。

10

【0023】

式IVの粗エノールエステルを反応させて式Iの化合物に転位させる反応は、塩基の存在下、また適宜シアノ化合物の存在下、溶剤中、20~40で行われることが有利である。

【0024】

使用することができる溶剤の例としては、アセトニトリル、塩化メチレン、1,2-ジクロロエタン、ジオキサン、酢酸エチル、トルエン、又はこれらの混合物である。好ましい溶剤は、アセトニトリル及びジオキサンである。

20

【0025】

適当な塩基は、第三級アミン（例えば、トリエチルアミン、ピリジン）、又はアルカリ金属炭酸塩（例えば、炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム）であり、これら塩基は上記エステルに対して等モル量で、又は4倍量までの過剰量で使用することが好ましい。トリエチルアミン又はアルカリ金属炭酸塩を用いることが好ましい。

【0026】

適当なシアノ化合物は、シアニ化ナトリウム、シアニ化カリウム等の無機シアノ化物、及びアセトンシアノヒドリン、トリメチルシリルシアニド等の有機シアノ化合物である。これらは、上記エステルに対して1~50モル%の量で使用される。アセトンシアノヒドリン又はトリメチルシリルシアニドを使用することが好ましく、例えば上記エステルに対して、5~15モル%、好ましくは10モル%の量で使用される。

30

【0027】

特に、アルカリ金属炭酸塩、例えば炭酸カリウムを、アセトニトリル又はジオキサン中で用いることが好ましい。

【0028】

後処理は、それ自体公知の方法で行われる。例えば、反応混合物を希薄な鉱酸（例えば、5%濃度の塩酸又は硫酸）で酸性化し、有機溶剤（例えば、塩化メチレン又は酢酸エチル）で抽出する。有機層を、5~10%濃度アルカリ金属炭酸塩溶液（例えば、炭酸ナトリウム溶液又は炭酸カリウム溶液）で抽出することができる。水層を酸性化し、形成した沈殿を吸引し、過及び/又は塩化メチレン若しくは酢酸エチルで抽出し、乾燥し、そして濃縮する。

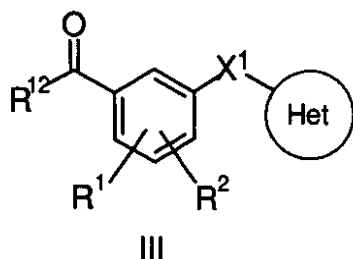
40

【0029】

式IIIで表される安息香酸は、新規である：

【0030】

【化9】



[但し、 R^1 と R^2 が、それぞれ水素、メルカプト、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシア
 ナト、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケ
 ニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-OR^3$ 、 $-OCOR^3$ 、 $-OSO_2R^3$ 、 $-S(O)_nR^3$ 、 $-$
 SO_2OR^3 、 $-SO_2N(R^3)_2$ 、 $-NR^3SO_2R^3$ 又は $-NR^3COR^3$ を表し；

R^3 が水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$
 アルキニル、フェニル又はフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、且つ上述のアルキル基は部
 分的に又は完全にハロゲン化されていても、及び/又は1～3個の下記の基：ヒドロキシ
 ル、メルカプト、アミノ、シアノ、 R^3 、 $-OR^3$ 、 $-SR^3$ 、 $-N(R^3)_2$ 、 $=NOR^3$ 、
 $-OCOR^3$ 、 $-SCOR^3$ 、 $-NR^3COR^3$ 、 $-CO_2R^3$ 、 $-COSR^3$ 、 $-CON(R^3)$
 $)_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキルイミノオキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカル
 ボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホ
 ニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルオキシ、フェニル、ベンジル、ヘテロアリール、
 フェノキシ、ベンジルオキシ及びヘテロアリールオキシ(最後の8個の基は置換されてい
 ても良い)を有していても良く；

n が0、1又は2を表し；

X^1 が直鎖又は分岐 $C_1 \sim C_6$ アルキレン鎖、 $C_2 \sim C_6$ アルケニレン鎖又は $C_2 \sim C_6$ アルキ
 ニレン鎖{これら鎖は、酸素又は硫黄から選択されるヘテロ原子により遮断されている}
 を表し、且つ上述のアルキル、アルケニル又はアルキニル基は、部分的にハロゲン化され
 ている、及び/又は1～3個の下記の基： $-OR^4$ 、 $-OCOR^4$ 、 $-OCONHR^4$ 又
 は $-OSO_2R^4$ から選択される基を有していても良く；

R^4 が水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、フェニル又
 はフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、且つ上述のアルキル、アルケニル又はアルキニル基
 は部分的に又は完全にハロゲン化されていても、及び/又は1個以上の下記の基：ヒドロ
 キシル、メルカプト、アミノ、シアノ、ニトロ、ホルミル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 C
 $_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル
 、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 C_1
 $\sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアル
 コキシから選択される基で置換されていても良く；

Hetが、3～6員の部分飽和若しくは完全飽和ヘテロシクリル基、又は3～6員のヘテ
 ロ芳香族基{これら基は、窒素、酸素又は硫黄から選択されるヘテロ原子を3個まで有す
 る}を表し、且つ上述のヘテロシクリル基又はヘテロ芳香族基は、部分的に又は完全にハ
 ロゲン化されていても、及び/又は R^5 で置換されていても良く；

R^5 が水素、ヒドロキシル、メルカプト、アミノ、シアノ、ニトロ、ホルミル、 $C_1 \sim C_4$
 アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$
 アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$
 ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ
 、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシを表し、且つ上記アルキル基は、それぞれ1個以上の下記の基
 :シアノ、ホルミル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アル
 コキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ
 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアル
 キルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシで置換されていても良く；

R^{12} がヒドロキシル又は加水分解可能な基を表す]。

10

20

30

40

50

【 0 0 3 1 】

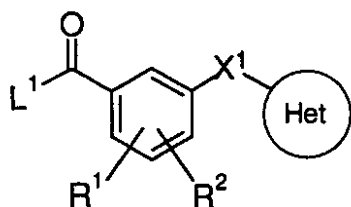
加水分解可能な基の例としては、アルコキシ、フェノキシ、アルキルチオ及びフェニルチオ（置換されていることもある）、ハロゲン化物、窒素を介して結合するヘテロアール基、アミノ及びイミノ基（置換されていることもある）、等である。

【 0 0 3 2 】

L^1 がハロゲンであるハロゲン化ベンゾイル I I I a（ R^{12} がハロゲンである I I I に該当）

【 0 0 3 3 】

【 化 1 0 】



IIIa

[但し、 R^1 、 R^2 、 X^1 及び H e t は式 I I I と同義であり、 L^1 はハロゲン、特に塩素又は臭素である]

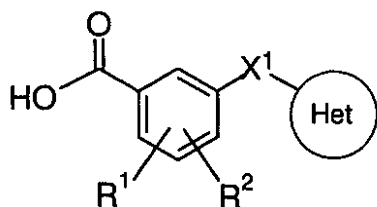
が好ましい。

【 0 0 3 4 】

さらに式 I I I b（ R^{12} がヒドロキシルである I I I に該当）

【 0 0 3 5 】

【 化 1 1 】



IIIb

[但し、 R^1 、 R^2 、 X^1 及び H e t は式 I I I と同義である]

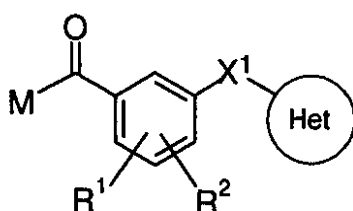
で表される安息香酸が好ましい。

【 0 0 3 6 】

さらに式 I I I c（ R^{12} が $C_1 \sim C_6$ アルコキシである I I I に該当）

【 0 0 3 7 】

【 化 1 2 】



IIIc

[但し、 R^1 、 R^2 、 X^1 及び H e t は式 I I I と同義であり、Mは $C_1 \sim C_6$ アルコキシである]

で表される安息香酸エステルが好ましい。

【 0 0 3 8 】

10

20

30

40

50

式 I I I の好ましい安息香酸について、式 I で表される 2 - ベンゾイルシクロヘキサン - 1, 3 - ジオンで述べたことは、基 R^1 、 R^2 、 X^1 及び Het に使用する。

【 0 0 3 9 】

式 I I I a (L^1 がハロゲン) の化合物は、文献 (L.G. Fieser, M. Fieser "Reagents for Organic Synthesis", 第 I 巻, 767 ~ 769 頁 (1967)、参照) により知られている類似の方法により、式 I I I b の安息香酸を、ハロゲン化剤 (例えば、塩化チオニル、臭化チオニル、ホスゲン、ジホスゲン、トリホスゲン、塩化オキサリル及び臭化オキサリル) と反応させて合成することができる。

【 0 0 4 0 】

式 I I I b の安息香酸は、特に式 I I I c の安息香酸エステル (M が $C_1 \sim C_6$ アルコキシ) を加水分解することにより得ることができる。

10

【 0 0 4 1 】

本発明の式 I I I c で表される安息香酸エステルは、下記の例に記載されているように、文献 (例えば、a : G. Dittus in Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, 第 V I / 3 巻, Oxygen compounds I, 第 4 版, 493 頁以下., Georg Thieme Verlag, 1965 ; b : T. L. Gilchrist, Heterocyclenchemie, 第 2 版, Verlag Chemie, 1995) 公知の種々の方法により製造することができる。

【 0 0 4 2 】

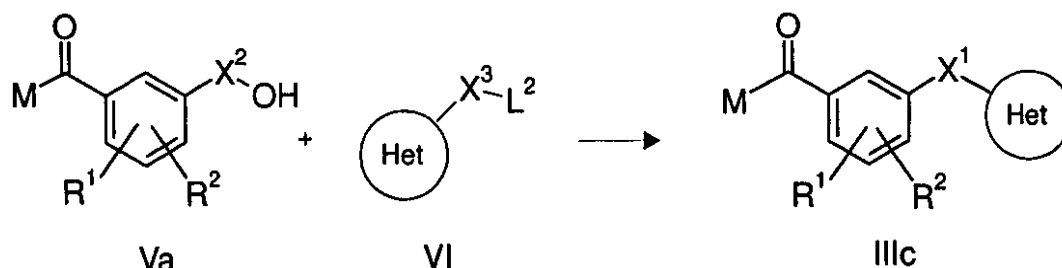
方法 B :

安息香酸エステル V a を適当な求核試薬 V I で置換して、本発明の安息香酸エステル I I I c を得る ;

20

【 0 0 4 3 】

【 化 1 3 】



30

[但し、 M 、 R^1 及び R^2 が、それぞれ上記と同義であり、 L^2 が適当な求核置換可能な脱離基、例えばハロゲン (例えば、臭素、塩素)、ヘテロアリアル (例えば、イミダゾリル、ピリジル)、カルボキシラート (例えば、アセタート、トリフルオロアセタート)、スルホナート (例えば、メシラート、トリフラート) 等を表し、

X^2 が、炭素原子が少なくとも 1 個で、最大 5 個の、直鎖又は分枝アルキレン鎖、アルケニレン鎖又はアルキニレン鎖 { 上述のアルキレン基、アルケニレン基又はアルキニレン基は、部分的にハロゲン化されていても、及び / 又は 1 ~ 3 個の下記の基 : $-OR^4$ 、 $-OCOR^4$ 、 $-OCONHR^4$ 又は $-OSO_2R^4$ から選択される基を有していても良い } を表し、

40

X^3 が、最大 5 個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝アルキレン鎖、アルケニレン鎖又はアルキニレン鎖 { 上述のアルキレン基、アルケニレン基又はアルキニレン基は部分的にハロゲン化されていても、及び / 又は 1 ~ 3 個の下記の基 : $-OR^4$ 、 $-OCOR^4$ 、 $-OCONHR^4$ 又は $-OSO_2R^4$ から選択される基を有していても良い } を表し、且つは $X^2O X^3$ は基 X^1 を形成する]。

【 0 0 4 4 】

一般に、出発材料は等モル量で用いられる。しかしながら、過剰量の出発材料又は他の成分を使用することが有利であろう。

【 0 0 4 5 】

50

適宜、反応を塩基の存在下で行うことが有利であろう。出発材料及び補助塩基は、等モル量で用いることが有利である。特定の場合、V a に対して、過剰量の補助塩基、例えば 1.5 ~ 3 モル等量用いることが有利であろう。

【0046】

適当な補助塩基は、第三級アルキルアミン（例えば、トリエチルアミン、ピリジン）、アルカリ金属炭酸塩（例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム）、アルカリ金属水素化物（例えば、水素化ナトリウム）である。トリエチルアミン、ピリジン及び炭酸カリウムを用いることが好ましい。

【0047】

適当な溶剤の例としては、塩素化炭化水素（例えば、塩化メチレン、1,2-ジクロロエタン）、芳香族炭化水素（例えば、トルエン、キシレン、クロロベンゼン）、エーテル（例えば、ジエチルエーテル、メチル tert-ブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン）、非プロトン性極性溶剤（例えば、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド）、又はエステル（例えば、酢酸エチル）、或いはこれらの混合物である。

【0048】

一般に反応温度は、0 ~ 反応混合物の沸点の間である。

【0049】

後処理は、それ自体公知の方法で行われる。

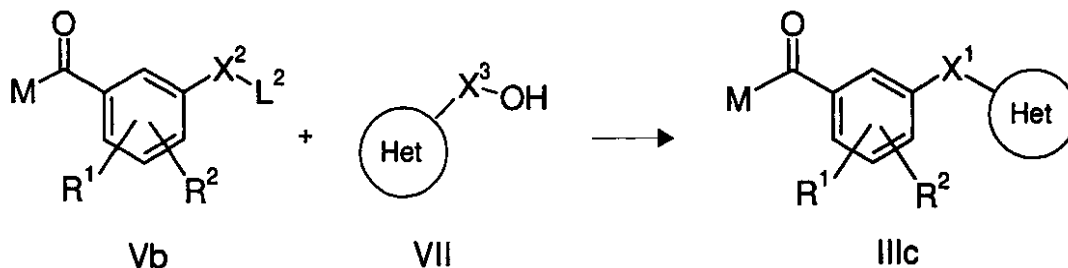
【0050】

方法 C :

適当な置換ヘテロシクリル V I I を安息香酸エステル V b で置換して、本発明の安息香酸エステル I I I c を得る；

【0051】

【化14】



[但し、M、R¹及びR²が、それぞれ上記と同義であり、L²が適当な求核置換可能な脱離基、例えばハロゲン（例えば、臭素、塩素）、ヘテロアリール（例えば、イミダゾリル、ピリジル）、カルボキシラート（例えば、アセタート、トリフルオロアセタート）、スルホナート（例えば、メシラート、トリフラート）等を表し、

X²が、炭素原子が少なくとも1個で、最大5個の、直鎖又は分枝アルキレン鎖、アルケニレン鎖又はアルキニレン鎖〔上述のアルキレン基、アルケニレン基又はアルキニレン基は、部分的にハロゲン化されていても、及び/又は1~3個の下記の基：-OR⁴、-OCOR⁴、-OCONHR⁴又は-OOSO₂R⁴から選択される基を有していても良い〕を表し、

X³が、最大5個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝アルキレン鎖、アルケニレン鎖又はアルキニレン鎖〔上述のアルキレン基、アルケニレン基又はアルキニレン基は部分的にハロゲン化されてても、及び/又は1~3個の下記の基：-OR⁴、-OCOR⁴、-OCONHR⁴又は-OOSO₂R⁴から選択される基を有していても良い〕を表し、且つはX²OX³は基X¹を形成する]。

【0052】

一般に、出発材料は等モル量で用いられる。しかしながら、過剰量の出発材料又は他の成

10

20

30

40

50

分を使用することが有利であろう。

【0053】

適宜、反応を塩基の存在下で行うことが有利であろう。出発材料及び補助塩基は、等モル量で用いることが有利である。特定の場合、V I I に対して、過剰量の補助塩基、例えば 1.5 ~ 3 モル等量用いることが有利であろう。

【0054】

適当な補助塩基は、第三級アルキルアミン（例えば、トリエチルアミン、ピリジン）、アルカリ金属炭酸塩（例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム）、アルカリ金属水素化物（例えば、水素化ナトリウム）である。トリエチルアミン、ピリジン及び炭酸カリウムを用いることが好ましい。

10

【0055】

適当な溶剤の例としては、塩素化炭化水素（例えば、塩化メチレン、1,2-ジクロロエタン）、芳香族炭化水素（例えば、トルエン、キシレン、クロロベンゼン）、エーテル（例えば、ジエチルエーテル、メチル tert-ブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン）、非プロトン性極性溶剤（例えば、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド）、又はエステル（例えば、酢酸エチル）、或いはこれらの混合物である。

【0056】

一般に反応温度は、0 ~ 反応混合物の沸点の間である。

【0057】

後処理は、それ自体公知の方法で行われる。

20

【0058】

本発明の式 I で表される以下の化合物が重要である。即ち、基 X^1 が、1 個の他の酸素又は硫黄原子を含む $C_1 \sim C_2$ アルキレン鎖又は C_2 アルケニレン鎖を表し、Het が、3 ~ 6 員の部分飽和若しくは完全飽和ヘテロシクリル基、又は窒素、酸素及び硫黄から選択される 3 個までのヘテロ原子を有する、3 ~ 6 員のヘテロ芳香族基 { このヘテロシクリル基又はヘテロ芳香族基は、部分的に又は完全にハロゲン化されていても、及び / 又は R^5 で置換されていても良い } を表す。

【0059】

さらに、本発明の式 I で表される以下の化合物が重要である。即ち、Het が、5 員若しくは 6 員の部分飽和若しくは完全飽和のヘテロシクリル基、又は窒素、酸素及び硫黄から選択される 3 個までのヘテロ原子を有する、5 員若しくは 6 員のヘテロ芳香族基 { このヘテロシクリル基又はヘテロ芳香族基は、部分的に又は完全にハロゲン化されていても、及び / 又は R^5 で置換されていても良い } を表し；

30

R^5 が水素、ヒドロキシル、メルカプト、アミノ、シアノ、ニトロ、ホルミル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシを表し、且つ上記アルキル基は、それぞれ 1 個以上の下記の基：シアノ、ホルミル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシで置換されていても良い。

40

【0060】

置換基 $R^1 \sim R^{12}$ について、或いはフェニル、ヘテロアリール環及びヘテロシクリル環の基として記載された有機基は、個々の基の構成員をそれぞれ例示するための共通の用語を表す。全ての炭化水素鎖、即ち全てのアルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルイミノオキシ、アルコキシアミノ、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルコキシアルコキシカルボニル、アルケニル、シク

50

ロアルケニル、アルキニル部分は、直鎖でも分岐でも良い。特段述べない限り、ハロゲン置換基は、1個～5個の同一又は異なるハロゲンを有することが好ましい。ハロゲンは、それぞれフッ素、塩素、臭素又はヨウ素を表す。

【0061】

他の意味の例として、下記のことを挙げるができる：

$C_1 \sim C_4$ アルキル及び $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニルのアルキル部分：メチル、エチル、 n -プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル及び1, 1-ジメチルエチル；

$C_1 \sim C_6$ アルキル、及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル及び $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルのアルキル部分：上述の $C_1 \sim C_4$ アルキル、さらにペンチル、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、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-エチル-1-メチルプロピル及び1-エチル-3-メチルプロピル；

$C_1 \sim C_4$ ハロアルキル：部分的又は完全にフッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素で置換された上述の $C_1 \sim C_4$ アルキル基、例えばクロロメチル、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、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、2-ヨードエチル、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, 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、2-フルオロプロピル、3-フルオロプロピル、2, 2-ジフルオロプロピル、2, 3-ジフルオロプロピル、2-クロロプロピル、3-クロロプロピル、2, 3-ジクロロプロピル、2-ブロモプロピル、3-ブロモプロピル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、3, 3, 3-トリクロロプロピル、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、1-(フルオロメチル)-2-フルオロエチル、1-(クロロメチル)-2-クロロエチル、1-(ブロモメチル)-2-ブロモエチル、4-フルオロブチル、4-クロロブチル、4-ブロモブチル及びノナフルオロブチル；

$C_1 \sim C_6$ ハロアルキル及び $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニルのハロアルキル部分：上述の $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、さらに5-フルオロペンチル、5-クロロペンチル、5-ブロモペンチル、5-ヨードペンチル、ウンデカフルオロペンチル、6-フルオロヘキシル、6-クロロヘキシル、6-ブロモヘキシル、6-ヨードヘキシル及びドデカフルオロヘキシル；

$C_1 \sim C_4$ アルコキシ、及び $C_1 \sim C_4$ アルコシアマミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル及び $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルのアルコキシ部分：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-メチルプロポキシ及び1, 1-ジメチルエトキシ；

$C_1 \sim C_6$ アルコキシ、及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_2 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルのアルコキシ部分：上述の $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、さらにペントキシ、1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メトキシブトキシ、1, 1-ジメチルプロポキシ、1, 2-ジメチルプロポキシ、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-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

10

20

30

40

50

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
又は1 - エチル - 2 - メチルプロポキシ；

C₁ ~ C₄ハロアルコキシ：部分的又は完全にフッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素で置換
された上述のC₁ ~ C₄アルコキシ基、例えば、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、クロロジフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、2 - フ
ルオロエトキシ、2 - クロロエトキシ、2 - ブロモエトキシ、2 - ヨードエトキシ、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 - 2 , 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、2 - フルオロ
プロポキシ、3 - フルオロプロポキシ、2 - クロロプロポキシ、3 - クロロプロポキシ、
2 - ブロモプロポキシ、3 - ブロモプロポキシ、2 , 2 - ジフルオロプロポキシ、2 , 3
- ジフルオロプロポキシ、2 , 3 - ジクロロプロポキシ、3 , 3 , 3 - トリフルオロプロ
ポキシ、3 , 3 , 3 - トリクロロプロポキシ、2 , 2 , 3 , 3 , 3 - ペンタフルオロプロ
ポキシ、ヘプタフルオロプロポキシ、1 - (フルオロメチル) - 2 - フルオロエトキシ、
1 - (クロロメチル) - 2 - クロロエトキシ、1 - (ブロモメチル) - 2 - ブロモエトキ
シ、4 - フルオロプトキシ、4 - クロロプトキシ、4 - ブロモプトキシ又はノナフルオロ
プトキシ；

C₁ ~ C₄アルキルスルホニル (C₁ ~ C₄アルキル - S (= O)₂ -) : メチルスルホニル
、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、1 - メチルエチルスルホニル、ブチルスルホ
ニル、1 - メチルプロピルスルホニル、2 - メチルプロピルスルホニル及び1 , 1 - ジメ
チルエチルスルホニル；

C₁ ~ C₆アルキルスルホニル：上述のC₁ ~ C₄アルキルスルホニル、さらにペンチルスル
ホニル、1 - メチルブチルスルホニル、2 - メチルブチルスルホニル、3 - メチルブチル
スルホニル、2 , 2 - ジメチルプロピルスルホニル、1 - エチルプロピルスルホニル、1
 , 1 - ジメチルプロピルスルホニル、1 , 2 - ジメチルプロピルスルホニル、ヘキシルス
ルホニル、1 - メチルペンチルスルホニル、2 - メチルペンチルスルホニル、3 - メチル
ペンチルスルホニル、4 - メチルペンチルスルホニル、1 , 1 - ジメチルブチルスルホニ
ル、1 , 2 - ジメチルブチルスルホニル、1 , 3 - ジメチルブチルスルホニル、2 , 2 -
ジメチルブチルスルホニル、2 , 3 - ジメチルブチルスルホニル、3 , 3 - ジメチルブチ
ルスルホニル、1 - エチルブチルスルホニル、2 - エチルブチルスルホニル、1 , 1 , 2
 - トリメチルプロピルスルホニル、1 , 2 , 2 - トリメチルプロピルスルホニル、1 - エ
チル - 1 - メチルプロピルスルホニル及び1 - エチル - 2 - メチルプロピルスルホニル；

C₁ ~ C₆ハロアルキルスルホニル：部分的又は完全にフッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ
素で置換された上述のC₁ ~ C₆アルキルスルホニル基、例えばフルオロメチルスルホニル
、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、クロロジフルオロメチ
ルスルホニル、ブロモジフルオロメチルスルホニル、2 - フルオロエチルスルホニル、2
 - クロロエチルスルホニル、2 - ブロモエチルスルホニル、2 - ヨードエチルスルホニル
、2 , 2 - ジフルオロエチルスルホニル、2 , 2 , 2 - トリフルオロエチルスルホニル、
2 , 2 , 2 - トリクロロエチルスルホニル、2 - クロロ - 2 - フルオロエチルスルホニル
、2 - クロロ - 2 , 2 - ジフルオロエチルスルホニル、2 , 2 - ジクロロ - 2 - フルオロ
エチルスルホニル、ペンタフルオロエチルスルホニル、2 - フルオロプロピルスルホニル
、3 - フルオロプロピルスルホニル、2 - クロロプロピルスルホニル、3 - クロロプロピ
ルスルホニル、2 - ブロモプロピルスルホニル、3 - ブロモプロピルスルホニル、2 , 2
 - ジフルオロプロピルスルホニル、2 , 3 - ジフルオロプロピルスルホニル、2 , 3 - ジ
クロロプロピルスルホニル、3 , 3 , 3 - トリフルオロプロピルスルホニル、3 , 3 , 3
 - トリクロロプロピルスルホニル、2 , 2 , 3 , 3 , 3 - ペンタフルオロプロピルスルホ
ニル、ヘプタフルオロプロピルスルホニル、1 - (フルオロメチル) - 2 - フルオロエチ
ルスルホニル、1 - (クロロメチル) - 2 - クロロエチルスルホニル、1 - (ブロモメチ
ル) - 2 - ブロモエチルスルホニル、4 - フルオロブチルスルホニル、4 - クロロブチル
スルホニル、4 - ブロモブチルスルホニル、ノナフルオロブチルスルホニル、5 - フルオ

10

20

30

40

50

ロペンチルスルホニル、5 - クロロペンチルスルホニル、5 - プロモペンチルスルホニル、5 - ヨードペンチルスルホニル、6 - フルオロヘキシルスルホニル、6 - プロモヘキシルスルホニル、6 - ヨードヘキシルスルホニル及びドデカフルオロヘキシルスルホニル；
 $C_1 \sim C_4$ アルキルイミノオキシ：メチルイミノオキシ、エチルイミノオキシ、1 - プロピルイミノオキシ、2 - プロピルイミノオキシ、1 - ブチルイミノオキシ及び2 - ブチルイミノオキシ；

$C_3 \sim C_6$ アルケニル：プロパ - 1 - エン - 1 - イル、プロパ - 2 - エン - 1 - イル、1 - メチルエテニル、ブテン - 1 - イル、ブテン - 2 - イル、ブテン - 3 - イル、1 - メチルプロパ - 1 - エン - 1 - イル、2 - メチルプロパ - 1 - エン - 1 - イル、1 - メチルプロパ - 2 - エン - 1 - イル、2 - メチルプロパ - 2 - エン - 1 - イル、ペンテン - 1 - イル、ペンテン - 2 - イル、ペンテン - 3 - イル、ペンテン - 4 - イル、1 - メチルブタ - 1 - エン - 1 - イル、2 - メチルブタ - 1 - エン - 1 - イル、3 - メチルブタ - 1 - エン - 1 - イル、1 - メチルブタ - 2 - エン - 1 - イル、2 - メチルブタ - 2 - エン - 1 - イル、3 - メチルブタ - 2 - エン - 1 - イル、1 - メチルブタ - 3 - エン - 1 - イル、2 - メチルブタ - 3 - エン - 1 - イル、3 - メチルブタ - 3 - エン - 1 - イル、1, 1 - ジメチルプロパ - 2 - エン - 1 - イル、1, 2 - ジメチルプロパ - 1 - エン - 1 - イル、1, 2 - ジメチルプロパ - 2 - エン - 1 - イル、1 - エチルプロパ - 1 - エン - 2 - イル、1 - エチルプロパ - 2 - エン - 1 - イル、ヘキサ - 1 - エン - 1 - イル、ヘキサ - 2 - エン - 1 - イル、ヘキサ - 3 - エン - 1 - イル、ヘキサ - 4 - エン - 1 - イル、ヘキサ - 5 - エン - 1 - イル、1 - メチルペンタ - 1 - エン - 1 - イル、2 - メチルペンタ - 1 - エン - 1 - イル、3 - メチルペンタ - 1 - エン - 1 - イル、4 - メチルペンタ - 1 - エン - 1 - イル、1 - メチルペンタ - 2 - エン - 1 - イル、2 - メチルペンタ - 2 - エン - 1 - イル、3 - メチルペンタ - 2 - エン - 1 - イル、4 - メチルペンタ - 2 - エン - 1 - イル、1 - メチルペンタ - 3 - エン - 1 - イル、2 - メチルペンタ - 3 - エン - 1 - イル、3 - メチルペンタ - 3 - エン - 1 - イル、4 - メチルペンタ - 3 - エン - 1 - イル、1 - メチルペンタ - 4 - エン - 1 - イル、2 - メチルペンタ - 4 - エン - 1 - イル、3 - メチルペンタ - 4 - エン - 1 - イル、4 - メチルペンタ - 4 - エン - 1 - イル、1, 1 - ジメチルブタ - 2 - エン - 1 - イル、1, 1 - ジメチルブタ - 3 - エン - 1 - イル、1, 2 - ジメチルブタ - 1 - エン - 1 - イル、1, 2 - ジメチルブタ - 2 - エン - 1 - イル、1, 2 - ジメチルブタ - 3 - エン - 1 - イル、1, 3 - ジメチルブタ - 1 - エン - 1 - イル、1, 3 - ジメチルブタ - 2 - エン - 1 - イル、1, 3 - ジメチルブタ - 3 - エン - 1 - イル、2, 2 - ジメチルブタ - 3 - エン - 1 - イル、2, 3 - ジメチルブタ - 1 - エン - 1 - イル、2, 3 - ジメチルブタ - 2 - エン - 1 - イル、2, 3 - ジメチルブタ - 3 - エン - 1 - イル、3, 3 - ジメチルブタ - 1 - エン - 1 - イル、3, 3 - ジメチルブタ - 2 - エン - 1 - イル、1 - エチルブタ - 1 - エン - 1 - イル、1 - エチルブタ - 2 - エン - 1 - イル、1 - エチルブタ - 3 - エン - 1 - イル、2 - エチルブタ - 1 - エン - 1 - イル、2 - エチルブタ - 2 - エン - 1 - イル、2 - エチルブタ - 3 - エン - 1 - イル、1, 1, 2 - トリメチルプロパ - 2 - エン - 1 - イル、1 - エチル - 1 - メチルプロパ - 2 - エン - 1 - イル、1 - エチル - 2 - メチルプロパ - 1 - エン - 1 - イル及び1 - エチル - 2 - メチルプロパ - 2 - エン - 1 - イル；

$C_2 \sim C_6$ アルケニル：上述の $C_3 \sim C_6$ アルケニル及びエテニル；

$C_3 \sim C_6$ アルキニル：プロパ - 1 - イン - 1 - イル、プロパ - 2 - イン - 1 - イル、ブタ - 1 - イン - 1 - イル、ブタ - 1 - イン - 3 - イル、ブタ - 1 - イン - 4 - イル、ブタ - 2 - イン - 1 - イル、ペンタ - 1 - イン - 1 - イル、ペンタ - 1 - イン - 3 - イル、ペンタ - 1 - イン - 4 - イル、ペンタ - 1 - イン - 5 - イル、ペンタ - 2 - イン - 1 - イル、ペンタ - 2 - イン - 4 - イル、ペンタ - 2 - イン - 5 - イル、3 - メチルブタ - 1 - イン - 3 - イル、3 - メチルブタ - 1 - イン - 4 - イル、ヘキサ - 1 - イン - 1 - イル、ヘキサ - 1 - イン - 3 - イル、ヘキサ - 1 - イン - 4 - イル、ヘキサ - 1 - イン - 5 - イル、ヘキサ - 1 - イン - 6 - イル、ヘキサ - 2 - イン - 1 - イル、ヘキサ - 2 - イン - 4 - イル、ヘキサ - 2 - イン - 5 - イル、ヘキサ - 2 - イン - 6 - イル、ヘキサ - 3 - イン - 1

10

20

30

40

50

-イル、ヘキサ-3-イン-2-イル、3-メチルペンタ-1-イン-1-イル、3-メチルペンタ-1-イン-3-イル、3-メチルペンタ-1-イン-4-イル、3-メチルペンタ-1-イン-5-イル、4-メチルペンタ-1-イン-1-イル、4-メチルペンタ-2-イン-4-イル及び4-メチルペンタ-2-イン-5-イル；

C₂~C₆アルキニル：上述のC₃~C₆アルキニル及びエチニル；

C₃~C₆シクロアルキル：シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシル；

C₄~C₆シクロアルケニル：シクロブテン-1-イル、シクロブテン-3-イル、シクロペンテン-1-イル、シクロペンテン-3-イル、シクロペンテン-4-イル、シクロヘキセン-1-イル、シクロヘキセン-3-イル及びシクロヘキセン-4-イル；

ヘテロシクリル、及びヘテロシクリルオキシのヘテロシクリル基：酸素、窒素及び硫黄原子から選ばれる1~3個のヘテロ原子を有する3~7員の飽和又部分不飽和の単環もしくは多環ヘテロシクリル、例えば、オキシラニル、2-テトラヒドロフラニル、3-テトラヒドロフラニル、2-テトラヒドロチエニル、3-テトラヒドロチエニル、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル、3-イソオキサゾリジニル、4-イソオキサゾリジニル、5-イソオキサゾリジニル、3-イソチアゾリジニル、4-イソチアゾリジニル、5-イソチアゾリジニル、3-ピラゾリジニル、4-ピラゾリジニル、5-ピラゾリジニル、2-オキサゾリジニル、4-オキサゾリジニル、5-オキサゾリジニル、2-チアゾリジニル、4-チアゾリジニル、5-チアゾリジニル、2-イミダゾリジニル、4-イミダゾリジニル、

1,2,4-オキサジアゾリジン-3-イル、1,2,4-オキサジアゾリジン-5-イル、1,2,4-チアジアゾリジン-3-イル、1,2,4-チアジアゾリジン-5-イル、1,2,4-トリアゾリジン-3-イル、1,3,4-オキサジアゾリジン-2-イル、1,3,4-チアジアゾリジン-2-イル、1,3,4-トリアゾリジン-2-イル、2,3-ジヒドロフラン-2-イル、2,3-ジヒドロフラン-3-イル、2,3-ジヒドロフラン-4-イル、2,3-ジヒドロフラン-5-イル、2,5-ジヒドロフラン-2-イル、2,5-ジヒドロフラン-3-イル、2,3-ジヒドロチエン-2-イル、2,3-ジヒドロチエン-3-イル、2,3-ジヒドロチエン-4-イル、2,3-ジヒドロチエン-5-イル、2,5-ジヒドロチエン-2-イル、2,5-ジヒドロチエン-3-イル、2,3-ジヒドロピロール-2-イル、2,3-ジヒドロピロール-3-イル、2,3-ジヒドロピロール-4-イル、2,3-ジヒドロピロール-5-イル、2,5-ジヒドロピロール-2-イル、2,5-ジヒドロピロール-3-イル、2,3-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル、2,3-ジヒドロイソオキサゾール-4-イル、2,3-ジヒドロイソオキサゾール-5-イル、4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル、4,5-ジヒドロイソオキサゾール-4-イル、4,5-ジヒドロイソオキサゾール-5-イル、2,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル、2,5-ジヒドロイソオキサゾール-4-イル、2,5-ジヒドロイソオキサゾール-5-イル、2,3-ジヒドロイソチアゾール-3-イル、2,3-ジヒドロイソチアゾール-4-イル、2,3-ジヒドロイソチアゾール-5-イル、4,5-ジヒドロイソチアゾール-3-イル、4,5-ジヒドロイソチアゾール-4-イル、4,5-ジヒドロイソチアゾール-5-イル、2,5-ジヒドロイソチアゾール-3-イル、2,5-ジヒドロイソチアゾール-4-イル、2,5-ジヒドロイソチアゾール-5-イル、2,3-ジヒドロピラゾール-3-イル、2,3-ジヒドロピラゾール-4-イル、2,3-ジヒドロピラゾール-5-イル、4,5-ジヒドロピラゾール-3-イル、4,5-ジヒドロピラゾール-4-イル、4,5-ジヒドロピラゾール-5-イル、2,5-ジヒドロピラゾール-3-イル、2,5-ジヒドロピラゾール-4-イル、2,5-ジヒドロピラゾール-5-イル、2,3-ジヒドロオキサゾール-2-イル、2,3-ジヒドロオキサゾール-4-イル、2,3-ジヒドロオキサゾール-5-イル、4,5-ジヒドロオキサゾール-2-イル、4,5-ジヒドロオキサゾール-4-イル、4,5-ジヒドロオキサゾール-5-イル、2,5-ジヒドロオキサゾール-2-イル、2,5-ジヒドロオキサゾール-4-イル、2,5-ジヒドロオキサゾール-5-イル、2,3-ジヒドロチアゾール-2-イル、2,3-ジヒドロチア

10

20

30

40

50

ゾール - 4 - イル、 2 , 3 - ジヒドロチアゾール - 5 - イル、 4 , 5 - ジヒドロチアゾール - 2 - イル、 4 , 5 - ジヒドロチアゾール - 4 - イル、 4 , 5 - ジヒドロチアゾール - 5 - イル、 2 , 5 - ジヒドロチアゾール - 2 - イル、 2 , 5 - ジヒドロチアゾール - 4 - イル、 2 , 5 - ジヒドロチアゾール - 5 - イル、 2 , 3 - ジヒドロイミダゾール - 2 - イル、 2 , 3 - ジヒドロイミダゾール - 4 - イル、 2 , 3 - ジヒドロイミダゾール - 5 - イル、 4 , 5 - ジヒドロイミダゾール - 2 - イル、 4 , 5 - ジヒドロイミダゾール - 4 - イル、 4 , 5 - ジヒドロイミダゾール - 5 - イル、 2 , 5 - ジヒドロイミダゾール - 2 - イル、 2 , 5 - ジヒドロイミダゾール - 4 - イル、 2 , 5 - ジヒドロイミダゾール - 5 - イル、 2 - モルホリニル、 3 - モルホリニル、 2 - ピペリジニル、 3 - ピペリジニル、 4 - ピペリジニル、 3 - テトラヒドロピリダジニル、 4 - テトラヒドロピリダジニル、 2 - テトラヒドロピリミジニル、 4 - テトラヒドロピリミジニル、 5 - テトラヒドロピリミジニル、 2 - テトラヒドロピラジニル、 1 , 3 , 5 - テトラヒドロトリアジン - 2 - イル、 1 , 2 , 4 - テトラヒドロトリアジン - 3 - イル、 1 , 3 - ジヒドロオキサジン - 2 - イル、 1 , 3 - ジチアン - 2 - イル、 2 - テトラヒドロピラニル、 3 - テトラヒドロピラニル、 4 - テトラヒドロピラニル、 2 - テトラヒドロチオピラニル、 3 - テトラヒドロチオピラニル、 4 - テトラヒドロチオピラニル、 1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イル、 3 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピリジン - 2 - イル、 4 H - 1 , 3 - チアジン - 2 - イル、 4 H - 3 , 1 - ベンゾチアジン - 2 - イル、 1 , 1 - ジオキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロチエン - 2 - イル、 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 3 - イル、 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 3 - イル、 1 , 3 - ジヒドロオキサジン - 2 - イル ;

10

20

ヘテロアリアル、及びヘテロアリアルオキシのヘテロアリアル基：炭素環員とは別に、 1 ~ 4 個の窒素原子、又は 1 ~ 3 個の窒素原子と 1 個の酸素又は硫黄原子、又は 1 個の酸素原子、又は 1 個の硫黄原子をさらに有していても良い芳香族の単環もしくは多環基、例えば、 2 - フリル、 3 - フリル、 2 - チエニル、 3 - チエニル、 2 - ピロリル、 3 - ピロリル、 3 - イソオキサゾリル、 4 - イソオキサゾリル、 5 - イソオキサゾリル、 3 - イソチアゾリル、 4 - イソチアゾリル、 5 - イソチアゾリル、 3 - ピラゾリル、 4 - ピラゾリル、 5 - ピラゾリル、 2 - オキサゾリル、 4 - オキサゾリル、 5 - オキサゾリル、 2 - チアゾリル、 4 - チアゾリル、 5 - チアゾリル、 2 - イミダゾリル、 4 - イミダゾリル、 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル、 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 5 - イル、 1 , 2 , 4 - チアジアゾール - 3 - イル、 1 , 2 , 4 - チアジアゾール - 5 - イル、 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - イル、 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル、 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - イル、 1 , 3 , 4 - トリアゾール - 2 - イル、 2 - ピリジニル、 3 - ピリジニル、 4 - ピリジニル、 3 - ピリダジニル、 4 - ピリダジニル、 2 - ピリミジニル、 4 - ピリミジニル、 5 - ピリミジニル、 2 - ピラジニル、 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イル、 1 , 2 , 4 - トリアジン - 3 - イル、 1 , 2 , 4 , 5 - テトラジン - 3 - イル、及び対応するベンゾ縮合誘導体。

30

40

【 0 0 6 2 】

全てのフェニル、ヘテロアリアル及びヘテロシクリル環（複素環）は、非置換あるか、或いは 1 ~ 3 個のハロゲン原子及び / 又は 1 個又は 2 個の下記の基：ニトロ、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ又はメトキシカルボニルから選択される基を有することが好ましい。

【 0 0 6 3 】

本発明の式 I の化合物を除草剤として使用する観点から、上記記号が、それぞれ単独で又は組み合わせて下記の意味を有することが好ましい：

R^1 がニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-OR^3$ 又は $-S(O)_nR^3$ を表し、特に好ましくは、ニトロ、ハロゲン（例えば、フッ素、塩素又は臭素）、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-OR^3$ 、又は $-SO_2R^3$ を表し；

R^2 が水素、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アル

50

キニル、 $-OR^3$ 又は $-S(O)_nR^3$ を表し、特に好ましくは、水素、ニトロ、ハロゲン（例えば、フッ素、塩素又は臭素）、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-OR^3$ 又は $-SO_2R^3$ を表し；

R^3 が水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、フェニル又はフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、特に好ましくは水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルケニル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル又はフェニルを表し、且つ上述のアルキル基は部分的に又は完全にハロゲン化されていても、及び/又は1～3個の下記の基：ヒドロキシル、メルカプト、アミノ、シアノ、 R^3 、 $-OR^3$ 、 $-SR^3$ 、 $-N(R^3)_2$ 、 $=NOR^3$ 、 $-OCOR^3$ 、 $-SCOR^3$ 、 $-NR^3COR^3$ 、 $-CO_2R^3$ 、 $-COSR^3$ 、 $-CON(R^3)_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキルイミノオキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルオキシ、フェニル、ベンジル、ヘテロアリール、フェノキシ、ベンジルオキシ及びヘテロアリールオキシ{最後の8個の基は置換されていても良い}を有していても良く、

さらに R^3 が水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、フェニル又はフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルを表すことが好ましく、且つ上述のアルキル基は部分的に又は完全にハロゲン化されていても、及び/又は1～3個の下記の基：ヒドロキシル、メルカプト、アミノ、シアノ、 $R^{3'}$ 、 $-OR^{3'}$ 、 $-SR^{3'}$ 、 $-N(R^{3'})_2$ 、 $=NOR^{3'}$ 、 $-OCOR^{3'}$ 、 $-SCOR^{3'}$ 、 $-NR^{3'}COR^{3'}$ 、 $-CO_2R^{3'}$ 、 $-COSR^{3'}$ 、 $-CON(R^{3'})_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキルイミノオキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルオキシ、フェニル、ベンジル、ヘテロアリール、フェノキシ、ベンジルオキシ及びヘテロアリールオキシ{最後の8個の基は置換されていても良い}を有していても良く[但し、 $R^{3'}$ は水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、フェニル又はフェニル $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す]；

n が0、1又は2、特に好ましくは0又は2を表し；

X^1 が直鎖又は分岐 $C_1 \sim C_4$ アルキレン鎖、 $C_2 \sim C_4$ アルケニレン鎖又は $C_2 \sim C_4$ アルキニレン鎖、特に好ましくはエチレン、プロピレン、プロペニレン又はプロピニレン鎖{これらの鎖は、酸素又は硫黄(好ましくは酸素)から選択されるヘテロ原子により遮断されている}を表し、且つ上述のアルキレン、アルケニレン又はアルキニレン基は、部分的にハロゲン化されていても、及び/又は1～3個の下記の基： $-OR^4$ 、 $-OCOR^4$ 、 $-OCONHR^4$ 又は $-OSO_2R^4$ から選択される基を有していても良く；

R^4 が水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、特に好ましくは水素、メチル、エチル又はトリフルオロメチルを表し；

R^5 が水素、ヒドロキシル、メルカプト、アミノ、シアノ、ニトロ、ホルミル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシを表し、且つ上記アルキル基は、それぞれ1個以上の下記の基：シアノ、ホルミル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシで置換されていても良い。

【0064】

R^6 、 R^7 、 R^9 及び R^{11} が、それぞれ水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキル、特に好ましくは水素、メチル又はエチルを表し；

R^8 が水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル{最後の2個の基は1～3個の下記の基：ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ アルキルチオから選択される置換基を有していても良い}を表し、或いは

10

20

30

40

50

テトラヒドロピラン - 2 - イル、テトラヒドロピラン - 3 - イル、テトラヒドロピラン - 4 - イル、テトラヒドロチオピラン - 2 - イル、テトラヒドロチオピラン - 3 - イル、テトラヒドロチオピラン - 4 - イル、1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル、1, 3 - ジオキサン - 2 - イル、1, 3 - オキサチオラン - 2 - イル、1, 3 - オキサチアン - 2 - イル、1, 3 - ジチアン - 2 - イル又は1, 3 - ジチオラン - 2 - イル{最後の6個の基は1~3個のC₁~C₄アルキル基を有していても良い}、特に好ましくは水素、メチル、エチル、シクロプロピル、ジ(メトキシ)メチル、ジ(エトキシ)メチル、2 - エチルチオプロピル、テトラヒドロピラン - 2 - イル、テトラヒドロピラン - 3 - イル、テトラヒドロピラン - 4 - イル、テトラヒドロチオピラン - 2 - イル、テトラヒドロチオピラン - 3 - イル、テトラヒドロチオピラン - 4 - イル、1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル、1, 3 - ジオキサン - 2 - イル、5, 5 - ジメチル - 1, 3 - ジオキサン - 2 - イル、1, 3 - オキサチオラン - 2 - イル、1, 3 - オキサチアン - 2 - イル、1, 3 - ジチオラン - 2 - イル、5, 5 - ジメチル - 1, 3 - ジチアン - 2 - イル又は1 - メチルチオシクロプロピルを表し；

10

R¹⁰が水素、C₁~C₄アルキル又はC₁~C₄アルコキシカルボニル、特に好ましくは水素、メチル又はメトキシカルボニルを表す。

【0065】

同様に、R⁸とR¹¹が二重結合系発生の素になる 結合を形成することが有利であろう。

【0066】

或いは、C R⁸ R⁹単位がC = Oで置き換えられていることは有利であろう。

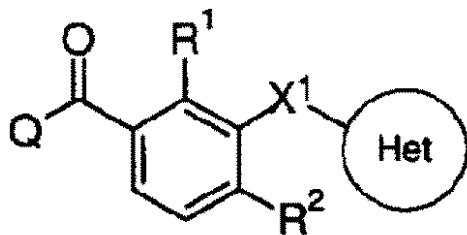
20

【0067】

R¹がベンゼン環の2位に、そしてR²がベンゼン環の4位に結合する式I aで表される化合物が特に好ましい。

【0068】

【化15】



30

Ia

以下の式I aで表される化合物が最も好ましい。即ち、置換基R¹、R²及びQがそれぞれ上記と同義であり、X¹が、1個の他の酸素原子を含むC₁~C₂アルキレン鎖又はC₂アルケニレン鎖を表し、そしてHetが、3~6員、好ましくは5員又は6員の部分飽和若しくは完全飽和ヘテロシクリル基、又は下記の3個の群：即ち、窒素、酸素と少なくとも1個の窒素との組み合わせ、又は硫黄と少なくとも1個の窒素との組み合わせ、特に好ましくは以下の2個の群：即ち、窒素、又は酸素と少なくとも1個の窒素との組み合わせから選択される3個まで、特に好ましくは1個又は2個のヘテロ原子を有する、3~6員、好ましくは5員又は6員のヘテロ芳香族基を表し、且つこのヘテロシクリル基又はヘテロ芳香族基は、部分的に又は完全にハロゲン化されていても、及び/又はR⁵で置換されていても良い。

40

【0069】

さらに、以下の、本発明の式I aで表される化合物が極めて最も好ましい。即ち、置換基R¹、R²及びX¹がそれぞれ上記と同義であり、Hetが、5員又は6員の部分飽和若しくは完全飽和ヘテロシクリル基、又は下記の3個の群：即ち、窒素、酸素と少なくとも1個の窒素との組み合わせ、又は硫黄と少なくとも1個の窒素との組み合わせ、特に好ましくは以下の2個の群：即ち、窒素、又は酸素と少なくとも1個の窒素との組み合わせ

50

から選択される3個まで、特に好ましくは1個又は2個のヘテロ原子を有する、5員又は6員のヘテロ芳香族基、を表し、且つこのヘテロシクリル基又はヘテロ芳香族基は、部分的に又は完全にハロゲン化されていても、及び/又はR⁵で置換されていても良い。

【0070】

下記の表1～36の化合物I bが特に好ましい。

【0071】

【表1】

表 A

No.	X ¹ *	Het
1	OCH ₂	オキシラニル
2	OCH ₂	3-メチル-2-オキシラニル
3	OCH ₂	2-オキセタニル
4	OCH ₂	3-ヒドロキシ-3-メチル-2-オキセタニル
5	OCH ₂	3-ヒドロキシ-3-エチル-2-オキセタニル
6	OCH ₂	3-ヒドロキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
7	OCH ₂	3-ヒドロキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
8	OCH ₂	3-メトキシ-3-メチル-2-オキセタニル
9	OCH ₂	3-メトキシ-3-エチル-2-オキセタニル
10	OCH ₂	3-メトキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
11	OCH ₂	3-メトキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
12	OCH ₂	3-トリメチル- シリルオキシ-3-メチル-2-オキセタニル
13	OCH ₂	3-トリメチル- シリルオキシ-3-エチル-2-オキセタニル
14	OCH ₂	3-トリメチル- シリルオキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
15	OCH ₂	3-トリメチル- シリルオキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
16	OCH ₂	3-オキセタニル
17	OCH ₂	2-フリル
18	OCH ₂	4,5-ジヒドロ-2-フリル
19	OCH ₂	2,3-ジヒドロ-2-フリル
20	OCH ₂	3-フリル
21	OCH ₂	4,5-ジヒドロ-3-フリル
22	OCH ₂	2,3-ジヒドロ-3-フリル
23	OCH ₂	2-チエニル
24	OCH ₂	4,5-ジヒドロ-2-チエニル
25	OCH ₂	2,3-ジヒドロ-2-チエニル
26	OCH ₂	5-クロロ-2-チエニル
27	OCH ₂	5-メチル-2-チエニル
28	OCH ₂	3-チエニル
29	OCH ₂	4,5-ジヒドロ-3-チエニル
30	OCH ₂	2,3-ジヒドロ-3-チエニル
31	OCH ₂	2-ピロリル
32	OCH ₂	2,5-ジヒドロ-2-ピロリル
33	OCH ₂	3-ピロリル

【表 2】

10

20

30

40

No.	X ¹ *	Het
34	OCH ₂	2,5-ジヒドロ-3-ピロリル
35	OCH ₂	3-イソオキサゾリル
36	OCH ₂	4-メチル-3-イソオキサゾリル
37	OCH ₂	5-メチル-3-イソオキサゾリル
38	OCH ₂	4,5-ジメチル-3-イソオキサゾリル
39	OCH ₂	4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
40	OCH ₂	4-メチル-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
41	OCH ₂	5-メチル-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
42	OCH ₂	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
43	OCH ₂	4-イソオキサゾリル
44	OCH ₂	3-メチル-4-イソオキサゾリル
45	OCH ₂	5-メチル-4-イソオキサゾリル
46	OCH ₂	5-シクロプロピル-4-イソオキサゾリル
47	OCH ₂	5-フェニル-4-イソオキサゾリル
48	OCH ₂	3,5-ジメチル-4-イソオキサゾリル
49	OCH ₂	4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
50	OCH ₂	3-メチル-4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
51	OCH ₂	5-メチル-4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
52	OCH ₂	3,5-ジメチル-4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
53	OCH ₂	5-イソオキサゾリル
54	OCH ₂	3-メチル-5-イソオキサゾリル
55	OCH ₂	4-メチル-5-イソオキサゾリル
56	OCH ₂	3,4-ジメチル-5-イソオキサゾリル
57	OCH ₂	4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
58	OCH ₂	3-メチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
59	OCH ₂	4-メチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
60	OCH ₂	3,4-ジメチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
61	OCH ₂	3-イソチアゾリル
62	OCH ₂	4-メチル-3-イソチアゾリル
63	OCH ₂	5-メチル-3-イソチアゾリル
64	OCH ₂	4-イソチアゾリル
65	OCH ₂	3-メチル-4-イソチアゾリル
66	OCH ₂	5-メチル-4-イソチアゾリル
67	OCH ₂	5-イソチアゾリル
68	OCH ₂	3-メチル-5-イソチアゾリル
69	OCH ₂	4-メチル-5-イソチアゾリル

【表3】

No.	X1 *	Het
70	OCH ₂	2-オキサゾリル
71	OCH ₂	4-オキサゾリル
72	OCH ₂	5-オキサゾリル
73	OCH ₂	2-チアゾリル
74	OCH ₂	4-チアゾリル
75	OCH ₂	5-チアゾリル
76	OCH ₂	3-ピラゾリル
77	OCH ₂	4-ピラゾリル
78	OCH ₂	1-メチル-3-ピラゾリル
79	OCH ₂	1-メチル-4-ピラゾリル
80	OCH ₂	1-メチル-5-ピラゾリル
81	OCH ₂	2-イミダゾリル
82	OCH ₂	1-メチル-2-イミダゾリル
83	OCH ₂	5-メチル- [1, 3, 4] -2-オキサジアゾリル
84	OCH ₂	5-メチル- [1, 2, 4] -3-オキサジアゾリル
85	OCH ₂	5-メチル- [1, 3, 4] -2-チアジアゾリル
86	OCH ₂	5-メチル- [1, 2, 4] -3-チアジアゾリル
87	OCH ₂	[1, 2, 4] -3-トリアゾリル
88	OCH ₂	[1, 2, 3] -4-トリアゾリル
89	OCH ₂	2-ピリジル
90	OCH ₂	6-クロロ-2-ピリジル
91	OCH ₂	6-メトキシ-2-ピリジル
92	OCH ₂	6-トリフルオロメチル-2-ピリジル
93	OCH ₂	3-ピリジル
94	OCH ₂	2-クロロ-3-ピリジル
95	OCH ₂	2-メトキシ-3-ピリジル
96	OCH ₂	4-ピリジル
97	OCH ₂	2-クロロ-4-ピリジル
98	OCH ₂	2-メトキシ-4-ピリジル
99	OCH ₂	2-エトキシ-4-ピリジル
100	OCH ₂	2-メチルチオ-4-ピリジル
101	OCH ₂	2-トリフルオロメチル-5-ピリジル
102	OCH ₂	2-ピリミジニル
103	OCH ₂	3-ピリミジニル
104	OCH ₂	4-ピリミジニル
105	OCH ₂	2-ピラジニル
106	OCH ₂	3-ピリダジニル
107	OCH ₂	4-ピリダジニル
108	OCH ₂	2-(2H-1,3-オキサジニル)

10

20

30

40

【表4】

No.	X ¹ *	Het
109	OCH ₂	2-(6H-1,3-オキサジニル)
110	OCH ₂	4-(6H-1,3-オキサジニル)
111	OCH ₂	6-(6H-1,3-オキサジニル)
112	OCH ₂	[1,3,5]-2-トリアジニル
113	OCH ₂	[1,2,4]-3-トリアジニル
114	OCH ₂	[1,2,4]-5-トリアジニル
115	OCH ₂	[1,2,4]-6-トリアジニル
116		オキシラニル
117		3-メチル-2-オキシラニル
118		2-オキセタニル
119		3-ヒドロキシ-3-メチル-2-オキセタニル
120		3-ヒドロキシ-3-エチル-2-オキセタニル
121		3-ヒドロキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
122		3-ヒドロキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
123		3-メトキシ-3-メチル-2-オキセタニル
124		3-メトキシ-3-エチル-2-オキセタニル
125		3-メトキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
126		3-メトキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
127		3-トリメチル- シリルオキシ-3-メチル-2-オキセタニル
128		3-トリメチル- シリルオキシ-3-エチル-2-オキセタニル
129		3-トリメチル- シリルオキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
130		3-トリメチル- シリルオキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
131		3-オキセタニル
132		2-フリル
133		4,5-ジヒドロ-2-フリル
134		2,3-ジヒドロ-2-フリル
135		3-フリル
136		4,5-ジヒドロ-3-フリル
137		2,3-ジヒドロ-3-フリル
138		2-チエニル
139	CH ₂ O	4,5-ジヒドロ-2-チエニル
140	CH ₂ O	2,3-ジヒドロ-2-チエニル
141	CH ₂ O	5-クロロ-2-チエニル
142	CH ₂ O	5-メチル-2-チエニル
143	CH ₂ O	3-チエニル

10

20

30

40

【表5】

No.	X ¹ *	Het
144	CH ₂ O	4,5-ジヒドロ-3-チエニル
145	CH ₂ O	2,3-ジヒドロ-3-チエニル
146	CH ₂ O	2-ピロリル
147	CH ₂ O	2,5-ジヒドロ-2-ピロリル
148	CH ₂ O	3-ピロリル
149	CH ₂ O	2,5-ジヒドロ-3-ピロリル
150	CH ₂ O	3-イソオキサゾリル
151	CH ₂ O	4-メチル-3-イソオキサゾリル
152	CH ₂ O	5-メチル-3-イソオキサゾリル
153	CH ₂ O	4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
154	CH ₂ O	4-メチル-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
155	CH ₂ O	4-メチル-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
156	CH ₂ O	5-メチル-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
157	CH ₂ O	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
158	CH ₂ O	4-イソオキサゾリル
159	CH ₂ O	3-メチル-4-イソオキサゾリル
160	CH ₂ O	5-メチル-4-イソオキサゾリル
161	CH ₂ O	5-シクロプロピル-4-イソオキサゾリル
162	CH ₂ O	5-フェニル-4-イソオキサゾリル
163	CH ₂ O	3,5-ジメチル-4-イソオキサゾリル
164	CH ₂ O	4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
165	CH ₂ O	3-メチル-4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
166	CH ₂ O	5-メチル-4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
167	CH ₂ O	3,5-ジメチル-4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
168	CH ₂ O	5-イソオキサゾリル
169	CH ₂ O	3-メチル-5-イソオキサゾリル
170	CH ₂ O	4-メチル-5-イソオキサゾリル
171	CH ₂ O	3,4-ジメチル-5-イソオキサゾリル
172	CH ₂ O	4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
173	CH ₂ O	3-メチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
174	CH ₂ O	4-メチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
175	CH ₂ O	3,4-ジメチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
176	CH ₂ O	3-イソチアゾリル
177	CH ₂ O	4-メチル-3-イソチアゾリル
178	CH ₂ O	5-メチル-3-イソチアゾリル
179	CH ₂ O	4-イソチアゾリル

10

20

30

40

【表6】

No.	X ¹ *	Het
180	CH ₂ O	3-メチル-4-イソチアゾリル
181	CH ₂ O	5-メチル-4-イソチアゾリル
182	CH ₂ O	5-イソチアゾリル
183	CH ₂ O	3-メチル-5-イソチアゾリル
184	CH ₂ O	4-メチル-5-イソチアゾリル
185	CH ₂ O	2-オキサゾリル
186	CH ₂ O	4-オキサゾリル
187	CH ₂ O	5-オキサゾリル
188	CH ₂ O	2-チアゾリル
189	CH ₂ O	4-チアゾリル
190	CH ₂ O	5-チアゾリル
191	CH ₂ O	3-ピラゾリル
192	CH ₂ O	4-ピラゾリル
193	CH ₂ O	1-メチル-3-ピラゾリル
194	CH ₂ O	1-メチル-4-ピラゾリル
195	CH ₂ O	1-メチル-5-ピラゾリル
196	CH ₂ O	2-イミダゾリル
197	CH ₂ O	1-メチル-2-イミダゾリル
198	CH ₂ O	5-メチル- [1, 3, 4] -2-オキサジアゾリル
199	CH ₂ O	5-メチル- [1, 2, 4] -3-オキサジアゾリル
200	CH ₂ O	5-メチル- [1, 3, 4] -2-チアジアゾリル
201	CH ₂ O	5-メチル- [1, 2, 4] -3-チアジアゾリル
202	CH ₂ O	[1, 2, 4] -3-トリアゾリル
203	CH ₂ O	[1, 2, 3] -4-トリアゾリル
204	CH ₂ O	2-ピリジル
205	CH ₂ O	6-クロロ-2-ピリジル
206	CH ₂ O	6-メトキシ-2-ピリジル
207	CH ₂ O	6-トリフルオロメチル-2-ピリジル
208	CH ₂ O	3-ピリジル
209	CH ₂ O	2-クロロ-3-ピリジル
210	CH ₂ O	2-メトキシ-3-ピリジル
211	CH ₂ O	4-ピリジル
212	CH ₂ O	2-クロロ-4-ピリジル
213	CH ₂ O	2-メトキシ-4-ピリジル
214	CH ₂ O	2-エトキシ-4-ピリジル
215	CH ₂ O	2-メチルチオ-4-ピリジル
216	CH ₂ O	2-トリフルオロメチル-5-ピリジル
217	CH ₂ O	2-ピリミジニル
218	CH ₂ O	3-ピリミジニル

10

20

30

40

【表7】

No.	X ¹ *	Het
219	CH ₂ O	4-ピリミジニル
220	CH ₂ O	2-ピラジニル
221	CH ₂ O	3-ピリダジニル
222	CH ₂ O	4-ピリダジニル
223	CH ₂ O	2-(2H-1,3-オキサジニル)
224	CH ₂ O	2-(6H-1,3-オキサジニル)
225	CH ₂ O	4-(6H-1,3-オキサジニル)
226	CH ₂ O	6-(6H-1,3-オキサジニル)
227	CH ₂ O	[1,3,5] -2-トリアジニル
228	CH ₂ O	[1,2,4] -3-トリアジニル
229	CH ₂ O	[1,2,4] -5-トリアジニル
230	CH ₂ O	[1,2,4] -6-トリアジニル
231	OCH ₂ CH ₂	オキシラニル
232	OCH ₂ CH ₂	3-メチル-2-オキシラニル
233	OCH ₂ CH ₂	2-オキセタニル
234	OCH ₂ CH ₂	3-ヒドロキシ-3-メチル-2-オキセタニル
235	OCH ₂ CH ₂	3-ヒドロキシ-3-エチル-2-オキセタニル
236	OCH ₂ CH ₂	3-ヒドロキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
237	OCH ₂ CH ₂	3-ヒドロキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
238	OCH ₂ CH ₂	3-メトキシ-3-メチル-2-オキセタニル
239	OCH ₂ CH ₂	3-メトキシ-3-エチル-2-オキセタニル
240	OCH ₂ CH ₂	3-メトキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
241	OCH ₂ CH ₂	3-メトキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
242	OCH ₂ CH ₂	3-トリメチル- シリルオキシ-3-メチル-2-オキセタニル
243	OCH ₂ CH ₂	3-トリメチル- シリルオキシ-3-エチル-2-オキセタニル
244	OCH ₂ CH ₂	3-トリメチル- シリルオキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
245	OCH ₂ CH ₂	3-トリメチル- シリルオキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
246	OCH ₂ CH ₂	3-オキセタニル
247	OCH ₂ CH ₂	2-フリル
248	OCH ₂ CH ₂	4,5-ジヒドロ-2-フリル
249	OCH ₂ CH ₂	2,3-ジヒドロ-2-フリル
250	OCH ₂ CH ₂	3-フリル
251	OCH ₂ CH ₂	4,5-ジヒドロ-3-フリル
252	OCH ₂ CH ₂	2,3-ジヒドロ-3-フリル
253	OCH ₂ CH ₂	2-チエニル

【表8】

10

20

30

40

No.	X ¹ *	Het
254	OCH ₂ CH ₂	4,5-ジヒドロ-2-チエニル
255	OCH ₂ CH ₂	2,3-ジヒドロ-2-チエニル
256	OCH ₂ CH ₂	5-クロロ-2-チエニル
257	OCH ₂ CH ₂	5-メチル-2-チエニル
258	OCH ₂ CH ₂	3-チエニル
259	OCH ₂ CH ₂	4,5-ジヒドロ-3-チエニル
260	OCH ₂ CH ₂	2,3-ジヒドロ-3-チエニル
261	OCH ₂ CH ₂	2-ピロリル
262	OCH ₂ CH ₂	2,5-ジヒドロ-2-ピロリル
263	OCH ₂ CH ₂	3-ピロリル
264	OCH ₂ CH ₂	2,5-ジヒドロ-3-ピロリル
265	OCH ₂ CH ₂	3-イソキサゾリル
266	OCH ₂ CH ₂	4-メチル-3-イソキサゾリル
267	OCH ₂ CH ₂	5-メチル-3-イソキサゾリル
268	OCH ₂ CH ₂	4,5-ジメチル-3-イソキサゾリル
269	OCH ₂ CH ₂	4,5-ジヒドロ-3-イソキサゾリル
270	OCH ₂ CH ₂	4-メチル-4,5-ジヒドロ-3-イソキサゾリル
271	OCH ₂ CH ₂	5-メチル-4,5-ジヒドロ-3-イソキサゾリル
272	OCH ₂ CH ₂	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロ-3- イソキサゾリル
273	OCH ₂ CH ₂	4-イソキサゾリル
274	OCH ₂ CH ₂	3-メチル-4-イソキサゾリル
275	OCH ₂ CH ₂	5-メチル-4-イソキサゾリル
276	OCH ₂ CH ₂	5-シクロプロピル-4-イソキサゾリル
277	OCH ₂ CH ₂	5-フェニル-4-イソキサゾリル
278	OCH ₂ CH ₂	3,5-ジメチル-4-イソキサゾリル
279	OCH ₂ CH ₂	4,5-ジヒドロ-4-イソキサゾリル
280	OCH ₂ CH ₂	3-メチル-4,5-ジヒドロ-4-イソキサゾリル
281	OCH ₂ CH ₂	5-メチル-4,5-ジヒドロ-4-イソキサゾリル
282	OCH ₂ CH ₂	3,5-ジメチル-4,5-ジヒドロ-4- イソキサゾリル
283	OCH ₂ CH ₂	5-イソキサゾリル
284	OCH ₂ CH ₂	3-メチル-5-イソキサゾリル
285	OCH ₂ CH ₂	4-メチル-5-イソキサゾリル
286	OCH ₂ CH ₂	3,4-ジメチル-5-イソキサゾリル
287	OCH ₂ CH ₂	4,5-ジヒドロ-5-イソキサゾリル
288	OCH ₂ CH ₂	3-メチル-4,5-ジヒドロ-5-イソキサゾリル
289	OCH ₂ CH ₂	4-メチル-4,5-ジヒドロ-5-イソキサゾリル

10

20

30

40

【表9】

No.	X ¹ *	Het
290	OCH ₂ CH ₂	3,4-ジメチル-4,5-ジヒドロ-5- イソキサゾリル
291	OCH ₂ CH ₂	3-イソチアゾリル
292	OCH ₂ CH ₂	4-メチル-3-イソチアゾリル
293	OCH ₂ CH ₂	5-メチル-3-イソチアゾリル
294	OCH ₂ CH ₂	4-イソチアゾリル
295	OCH ₂ CH ₂	3-メチル-4-イソチアゾリル
296	OCH ₂ CH ₂	5-メチル-4-イソチアゾリル
297	OCH ₂ CH ₂	5-イソチアゾリル
298	OCH ₂ CH ₂	3-メチル-5-イソチアゾリル
299	OCH ₂ CH ₂	4-メチル-5-イソチアゾリル
300	OCH ₂ CH ₂	2-オキサゾリル
301	OCH ₂ CH ₂	4-オキサゾリル
302	OCH ₂ CH ₂	5-オキサゾリル
303	OCH ₂ CH ₂	2-チアゾリル
304	OCH ₂ CH ₂	4-チアゾリル
305	OCH ₂ CH ₂	5-チアゾリル
306	OCH ₂ CH ₂	3-ピラゾリル
307	OCH ₂ CH ₂	4-ピラゾリル
308	OCH ₂ CH ₂	1-メチル-3-ピラゾリル
309	OCH ₂ CH ₂	1-メチル-4-ピラゾリル
310	OCH ₂ CH ₂	1-メチル-5-ピラゾリル
311	OCH ₂ CH ₂	2-イミダゾリル
312	OCH ₂ CH ₂	1-メチル-2-イミダゾリル
313	OCH ₂ CH ₂	5-メチル- [1, 3, 4] -2-オキサジアゾリル
314	OCH ₂ CH ₂	5-メチル- [1, 2, 4] -3-オキサジアゾリル
315	OCH ₂ CH ₂	5-メチル- [1, 3, 4] -2-チアジアゾリル
316	OCH ₂ CH ₂	5-メチル- [1, 2, 4] -3-チアジアゾリル
317	OCH ₂ CH ₂	[1, 2, 4] -3-トリアゾリル
318	OCH ₂ CH ₂	[1, 2, 3] -4-トリアゾリル
319	OCH ₂ CH ₂	2-ピリジル
320	OCH ₂ CH ₂	6-クロロ-2-ピリジル
321	OCH ₂ CH ₂	6-メトキシ-2-ピリジル
322	OCH ₂ CH ₂	6-トリフルオロメチル-2-ピリジル
323	OCH ₂ CH ₂	3-ピリジル
324	OCH ₂ CH ₂	2-クロロ-3-ピリジル
325	OCH ₂ CH ₂	2-メトキシ-3-ピリジル
326	OCH ₂ CH ₂	4-ピリジル
327	OCH ₂ CH ₂	2-クロロ-4-ピリジル

10

20

30

40

【表10】

No.	X1*	Het
328	OCH ₂ CH ₂	2-メトキシ-4-ピリジル
329	OCH ₂ CH ₂	2-エトキシ-4-ピリジル
330	OCH ₂ CH ₂	2-メチルチオ-4-ピリジル
331	OCH ₂ CH ₂	2-トリフルオロメチル-5-ピリジル
332	OCH ₂ CH ₂	2-ピリミジニル
333	OCH ₂ CH ₂	3-ピリミジニル
334	OCH ₂ CH ₂	4-ピリミジニル
335	OCH ₂ CH ₂	2-ピラジニル
336	OCH ₂ CH ₂	3-ピリダジニル
337	OCH ₂ CH ₂	4-ピリダジニル
338	OCH ₂ CH ₂	2-(2 <i>H</i> -1, 3-オキサジニル)
339	OCH ₂ CH ₂	2-(6 <i>H</i> -1, 3-オキサジニル)
340	OCH ₂ CH ₂	4-(6 <i>H</i> -1, 3-オキサジニル)
341	OCH ₂ CH ₂	6-(6 <i>H</i> -1, 3-オキサジニル)
342	OCH ₂ CH ₂	[1, 3, 5] -2-トリアジニル
343	OCH ₂ CH ₂	[1, 2, 4] -3-トリアジニル
344	OCH ₂ CH ₂	[1, 2, 4] -5-トリアジニル
345	OCH ₂ CH ₂	[1, 2, 4] -6-トリアジニル
346	CH ₂ CH ₂ O	オキシラニル
347	CH ₂ CH ₂ O	3-メチル-2-オキシラニル
348	CH ₂ CH ₂ O	2-オキセタニル
349	CH ₂ CH ₂ O	3-ヒドロキシ-3-メチル-2-オキセタニル
350	CH ₂ CH ₂ O	3-ヒドロキシ-3-エチル-2-オキセタニル
351	CH ₂ CH ₂ O	3-メトキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
352	CH ₂ CH ₂ O	3-メトキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
353	CH ₂ CH ₂ O	3-メトキシ-3-メチル-2-オキセタニル
354	CH ₂ CH ₂ O	3-メトキシ-3-エチル-2-オキセタニル
355	CH ₂ CH ₂ O	3-メトキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
356	CH ₂ CH ₂ O	3-メトキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
357	CH ₂ CH ₂ O	3-トリメチル- シリルオキシ-3-メチル-2-オキセタニル
358	CH ₂ CH ₂ O	3-トリメチル- シリルオキシ-3-エチル-2-オキセタニル
359	CH ₂ CH ₂ O	3-トリメチル- シリルオキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
360	CH ₂ CH ₂ O	3-トリメチル- シリルオキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
361	CH ₂ CH ₂ O	3-オキセタニル
362	CH ₂ CH ₂ O	2-フリル

【表 1 1】

No.	X ¹ *	Het
363	CH ₂ CH ₂ O	4,5-ジヒドロ-2-フリル
364	CH ₂ CH ₂ O	2,3-ジヒドロ-2-フリル
365	CH ₂ CH ₂ O	3-フリル
366	CH ₂ CH ₂ O	4,5-ジヒドロ-3-フリル
367	CH ₂ CH ₂ O	2,3-ジヒドロ-3-フリル
368	CH ₂ CH ₂ O	2-チエニル
369	CH ₂ CH ₂ O	4,5-ジヒドロ-2-チエニル
370	CH ₂ CH ₂ O	2,3-ジヒドロ-2-チエニル
371	CH ₂ CH ₂ O	5-クロロ-2-チエニル
372	CH ₂ CH ₂ O	5-メチル-2-チエニル
373	CH ₂ CH ₂ O	3-チエニル
374	CH ₂ CH ₂ O	4,5-ジヒドロ-3-チエニル
375	CH ₂ CH ₂ O	2,3-ジヒドロ-3-チエニル
376	CH ₂ CH ₂ O	2-ピロリル
377	CH ₂ CH ₂ O	2,5-ジヒドロ-2-ピロリル
378	CH ₂ CH ₂ O	3-ピロリル
379	CH ₂ CH ₂ O	2,5-ジヒドロ-3-ピロリル
380	CH ₂ CH ₂ O	3-イソオキサゾリル
381	CH ₂ CH ₂ O	4-メチル-3-イソオキサゾリル
382	CH ₂ CH ₂ O	5-メチル-3-イソオキサゾリル
383	CH ₂ CH ₂ O	4,5-ジメチル-3-イソオキサゾリル
384	CH ₂ CH ₂ O	4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
385	CH ₂ CH ₂ O	4-メチル-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
386	CH ₂ CH ₂ O	5-メチル-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
387	CH ₂ CH ₂ O	3,5-ジメチル-4,5-ジヒドロ-4- イソオキサゾリル
388	CH ₂ CH ₂ O	4-イソオキサゾリル
389	CH ₂ CH ₂ O	3-メチル-4-イソオキサゾリル
390	CH ₂ CH ₂ O	5-メチル-4-イソオキサゾリル
391	CH ₂ CH ₂ O	5-シクロプロピル-4-イソオキサゾリル
392	CH ₂ CH ₂ O	5-フェニル-4-イソオキサゾリル
393	CH ₂ CH ₂ O	3,5-ジメチル-4-イソオキサゾリル
394	CH ₂ CH ₂ O	4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
395	CH ₂ CH ₂ O	3-メチル-4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
396	CH ₂ CH ₂ O	5-メチル-4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
397	CH ₂ CH ₂ O	3,5-ジメチル-4,5-ジヒドロ-4- イソオキサゾリル
398	CH ₂ CH ₂ O	5-イソオキサゾリル
399	CH ₂ CH ₂ O	3-メチル-5-イソオキサゾリル

【表12】

No.	X ¹ *	Het
400	CH ₂ CH ₂ O	4-メチル-5-イソオキサゾリル
401	CH ₂ CH ₂ O	3,4-ジメチル-5-イソオキサゾリル
402	CH ₂ CH ₂ O	4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
403	CH ₂ CH ₂ O	3-メチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
404	CH ₂ CH ₂ O	4-メチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
405	CH ₂ CH ₂ O	3,4-ジメチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
406	CH ₂ CH ₂ O	3-イソチアゾリル
407	CH ₂ CH ₂ O	4-メチル-3-イソチアゾリル
408	CH ₂ CH ₂ O	5-メチル-3-イソチアゾリル
409	CH ₂ CH ₂ O	4-イソチアゾリル
410	CH ₂ CH ₂ O	3-メチル-4-イソチアゾリル
411	CH ₂ CH ₂ O	5-メチル-4-イソチアゾリル
412	CH ₂ CH ₂ O	5-イソチアゾリル
413	CH ₂ CH ₂ O	3-メチル-5-イソチアゾリル
414	CH ₂ CH ₂ O	4-メチル-5-イソチアゾリル
415	CH ₂ CH ₂ O	2-オキサゾリル
416	CH ₂ CH ₂ O	4-オキサゾリル
417	CH ₂ CH ₂ O	5-オキサゾリル
418	CH ₂ CH ₂ O	2-チアゾリル
419	CH ₂ CH ₂ O	4-チアゾリル
420	CH ₂ CH ₂ O	5-チアゾリル
421	CH ₂ CH ₂ O	3-ピラゾリル
422	CH ₂ CH ₂ O	4-ピラゾリル
423	CH ₂ CH ₂ O	1-メチル-3-ピラゾリル
424	CH ₂ CH ₂ O	1-メチル-4-ピラゾリル
425	CH ₂ CH ₂ O	1-メチル-5-ピラゾリル
426	CH ₂ CH ₂ O	2-イミダゾリル
427	CH ₂ CH ₂ O	1-メチル-2-イミダゾリル
428	CH ₂ CH ₂ O	5-メチル- [1, 3, 4] -2-オキサジアゾリル
429	CH ₂ CH ₂ O	5-メチル- [1, 2, 4] -3-オキサジアゾリル
430	CH ₂ CH ₂ O	5-メチル- [1, 3, 4] -2-チアジアゾリル
431	CH ₂ CH ₂ O	5-メチル- [1, 2, 4] -3-チアジアゾリル
432	CH ₂ CH ₂ O	[1, 2, 4] -3-トリアゾリル
433	CH ₂ CH ₂ O	[1, 2, 3] -4-トリアゾリル
434	CH ₂ CH ₂ O	2-ピリジル
435	CH ₂ CH ₂ O	6-クロロ-2-ピリジル
436	CH ₂ CH ₂ O	6-メトキシ-2-ピリジル
437	CH ₂ CH ₂ O	6-トリフルオロメチル-2-ピリジル

10

20

30

40

【表 1 3】

No.	X ¹ *	Het
438	CH ₂ CH ₂ O	3-ピリジル
439	CH ₂ CH ₂ O	2-クロロ-3-ピリジル
440	CH ₂ CH ₂ O	2-メトキシ-3-ピリジル
441	CH ₂ CH ₂ O	4-ピリジル
442	CH ₂ CH ₂ O	2-クロロ-4-ピリジル
443	CH ₂ CH ₂ O	2-メトキシ-4-ピリジル
444	CH ₂ CH ₂ O	2-エトキシ-4-ピリジル
445	CH ₂ CH ₂ O	2-メチルチオ-4-ピリジル
446	CH ₂ CH ₂ O	2-トリフルオロメチル-5-ピリジル
447	CH ₂ CH ₂ O	2-ピリミジニル
448	CH ₂ CH ₂ O	3-ピリミジニル
449	CH ₂ CH ₂ O	4-ピリミジニル
450	CH ₂ CH ₂ O	2-ピラジニル
451	CH ₂ CH ₂ O	3-ピリダジニル
452	CH ₂ CH ₂ O	4-ピリダジニル
453	CH ₂ CH ₂ O	2-(2H-1, 3-オキサジニル)
454	CH ₂ CH ₂ O	2-(6H-1, 3-オキサジニル)
455	CH ₂ CH ₂ O	4-(6H-1, 3-オキサジニル)
456	CH ₂ CH ₂ O	6-(6H-1, 3-オキサジニル)
457	CH ₂ CH ₂ O	[1, 3, 5] -2-トリアジニル
458	CH ₂ CH ₂ O	[1, 2, 4] -3-トリアジニル
459	CH ₂ CH ₂ O	[1, 2, 4] -5-トリアジニル
460	CH ₂ CH ₂ O	[1, 2, 4] -6-トリアジニル
461	CH ₂ OCH ₂	オキシラニル
462	CH ₂ OCH ₂	3-メチル-2-オキシラニル
463	CH ₂ OCH ₂	2-オキセタニル
464	CH ₂ OCH ₂	3-ヒドロキシ-3-メチル-2-オキセタニル
465	CH ₂ OCH ₂	3-ヒドロキシ-3-エチル-2-オキセタニル
466	CH ₂ OCH ₂	3-ヒドロキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
467	CH ₂ OCH ₂	3-ヒドロキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
468	CH ₂ OCH ₂	3-メトキシ-3-メチル-2-オキセタニル
469	CH ₂ OCH ₂	3-メトキシ-3-エチル-2-オキセタニル
470	CH ₂ OCH ₂	3-メトキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
471	CH ₂ OCH ₂	3-メトキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
472	CH ₂ OCH ₂	3-トリメチル- シリルオキシ-3-メチル-2-オキセタニル
473	CH ₂ OCH ₂	3-トリメチル- シリルオキシ-3-エチル-2-オキセタニル

【表14】

No.	X ¹ *	Het
474	CH ₂ OCH ₂	3-トリメチル- シリルオキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
475	CH ₂ OCH ₂	3-トリメチル- シリルオキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
476	CH ₂ OCH ₂	3-オキセタニル
477	CH ₂ OCH ₂	2-フリル
478	CH ₂ OCH ₂	4,5-ジヒドロ-2-フリル
479	CH ₂ OCH ₂	2,3-ジヒドロ-2-フリル
480	CH ₂ OCH ₂	3-フリル
481	CH ₂ OCH ₂	4,5-ジヒドロ-3-フリル
482	CH ₂ OCH ₂	2,3-ジヒドロ-3-フリル
483	CH ₂ OCH ₂	2-チエニル
484	CH ₂ OCH ₂	4,5-ジヒドロ-2-チエニル
485	CH ₂ OCH ₂	2,3-ジヒドロ-2-チエニル
486	CH ₂ OCH ₂	5-クロロ-2-チエニル
487	CH ₂ OCH ₂	5-メチル-2-チエニル
488	CH ₂ OCH ₂	3-チエニル
489	CH ₂ OCH ₂	4,5-ジヒドロ-3-チエニル
490	CH ₂ OCH ₂	2,3-ジヒドロ-3-チエニル
491	CH ₂ OCH ₂	2-ピロリル
492	CH ₂ OCH ₂	2,5-ジヒドロ-2-ピロリル
493	CH ₂ OCH ₂	3-ピロリル
494	CH ₂ OCH ₂	2,5-ジヒドロ-3-ピロリル
495	CH ₂ OCH ₂	3-イソオキサゾリル
496	CH ₂ OCH ₂	4-メチル-3-イソオキサゾリル
497	CH ₂ OCH ₂	5-メチル-3-イソオキサゾリル
498	CH ₂ OCH ₂	4,5-ジメチル-3-イソオキサゾリル
499	CH ₂ OCH ₂	4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
500	CH ₂ OCH ₂	4-メチル-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
501	CH ₂ OCH ₂	5-メチル-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
502	CH ₂ OCH ₂	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロ-3- イソオキサゾリル
503	CH ₂ OCH ₂	4-イソオキサゾリル
504	CH ₂ OCH ₂	3-メチル-4-イソオキサゾリル
505	CH ₂ OCH ₂	5-メチル-4-イソオキサゾリル
506	CH ₂ OCH ₂	5-シクロプロピル-4-イソオキサゾリル
507	CH ₂ OCH ₂	5-フェニル-4-イソオキサゾリル
508	CH ₂ OCH ₂	3,5-ジメチル-4-イソオキサゾリル
509	CH ₂ OCH ₂	4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル

【表15】

10

20

30

40

No.	X ¹ *	Het
510	CH ₂ OCH ₂	3-メチル-4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
511	CH ₂ OCH ₂	5-メチル-4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
512	CH ₂ OCH ₂	3,5-ジメチル-4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
513	CH ₂ OCH ₂	5-イソオキサゾリル
514	CH ₂ OCH ₂	3-メチル-5-イソオキサゾリル
515	CH ₂ OCH ₂	4-メチル-5-イソオキサゾリル
516	CH ₂ OCH ₂	3,4-ジメチル-5-イソオキサゾリル
517	CH ₂ OCH ₂	4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
518	CH ₂ OCH ₂	3-メチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
519	CH ₂ OCH ₂	4-メチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
520	CH ₂ OCH ₂	3,4-ジメチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
521	CH ₂ OCH ₂	3-イソチアゾリル
522	CH ₂ OCH ₂	4-メチル-3-イソチアゾリル
523	CH ₂ OCH ₂	5-メチル-3-イソチアゾリル
524	CH ₂ OCH ₂	4-イソチアゾリル
525	CH ₂ OCH ₂	3-メチル-4-イソチアゾリル
526	CH ₂ OCH ₂	5-メチル-4-イソチアゾリル
527	CH ₂ OCH ₂	5-イソチアゾリル
528	CH ₂ OCH ₂	3-メチル-5-イソチアゾリル
529	CH ₂ OCH ₂	4-メチル-5-イソチアゾリル
530	CH ₂ OCH ₂	2-オキサゾリル
531	CH ₂ OCH ₂	4-オキサゾリル
532	CH ₂ OCH ₂	5-オキサゾリル
533	CH ₂ OCH ₂	2-チアゾリル
534	CH ₂ OCH ₂	4-チアゾリル
535	CH ₂ OCH ₂	5-チアゾリル
536	CH ₂ OCH ₂	3-ピラゾリル
537	CH ₂ OCH ₂	4-ピラゾリル
538	CH ₂ OCH ₂	1-メチル-3-ピラゾリル
539	CH ₂ OCH ₂	1-メチル-4-ピラゾリル
540	CH ₂ OCH ₂	1-メチル-5-ピラゾリル
541	CH ₂ OCH ₂	2-イミダゾリル
542	CH ₂ OCH ₂	1-メチル-2-イミダゾリル
543	CH ₂ OCH ₂	5-メチル- [1, 3, 4] -2-オキサジアゾリル
544	CH ₂ OCH ₂	5-メチル- [1, 2, 4] -3-オキサジアゾリル
545	CH ₂ OCH ₂	5-メチル- [1, 3, 4] -2-チアジアゾリル
546	CH ₂ OCH ₂	5-メチル- [1, 2, 4] -3-チアジアゾリル

【表16】

No.	X ¹ *	Het
547	CH ₂ OCH ₂	[1, 2, 4] -3-トリアゾリル
548	CH ₂ OCH ₂	[1, 2, 3] -4-トリアゾリル
549	CH ₂ OCH ₂	2-ピリジル
550	CH ₂ OCH ₂	6-クロロ-2-ピリジル
551	CH ₂ OCH ₂	6-メトキシ-2-ピリジル
552	CH ₂ OCH ₂	6-トリフルオロメチル-2-ピリジル
553	CH ₂ OCH ₂	3-ピリジル
554	CH ₂ OCH ₂	2-クロロ-3-ピリジル
555	CH ₂ OCH ₂	2-メトキシ-3-ピリジル
556	CH ₂ OCH ₂	4-ピリジル
557	CH ₂ OCH ₂	2-クロロ-4-ピリジル
558	CH ₂ OCH ₂	2-メトキシ-4-ピリジル
559	CH ₂ OCH ₂	2-エトキシ-4-ピリジル
560	CH ₂ OCH ₂	2-メチルチオ-4-ピリジル
561	CH ₂ OCH ₂	2-トリフルオロメチル-5-ピリジル
562	CH ₂ OCH ₂	2-ピリミジニル
563	CH ₂ OCH ₂	3-ピリミジニル
564	CH ₂ OCH ₂	4-ピリミジニル
565	CH ₂ OCH ₂	2-ピラジニル
566	CH ₂ OCH ₂	3-ピリダジニル
567	CH ₂ OCH ₂	4-ピリダジニル
568	CH ₂ OCH ₂	2-(2H-1,3-オキサジニル)
569	CH ₂ OCH ₂	2-(6H-1,3-オキサジニル)
570	CH ₂ OCH ₂	4-(6H-1,3-オキサジニル)
571	CH ₂ OCH ₂	6-(6H-1,3-オキサジニル)
572	CH ₂ OCH ₂	[1, 3, 5] -2-トリアジニル
573	CH ₂ OCH ₂	[1, 2, 4] -3-トリアジニル
574	CH ₂ OCH ₂	[1, 2, 4] -5-トリアジニル
575	CH ₂ OCH ₂	[1, 2, 4] -6-トリアジニル
576	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	オキシラニル
577	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-メチル-2-オキシラニル
578	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-オキセタニル
579	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-ヒドロキシ-3-メチル-2-オキセタニル
580	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-ヒドロキシ-3-エチル-2-オキセタニル
581	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-ヒドロキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
582	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-ヒドロキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
583	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-メトキシ-3-メチル-2-オキセタニル
584	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-メトキシ-3-エチル-2-オキセタニル
585	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-メトキシ-3-プロピル-2-オキセタニル

【表17】

No.	X ¹ *	Het
586	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-メトキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
587	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-トリメチル- シリルオキシ-3-メチル-2-オキセタニル
588	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-トリメチル- シリルオキシ-3-エチル-2-オキセタニル
589	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-トリメチル- シリルオキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
590	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-トリメチル- シリルオキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
591	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-オキセタニル
592	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-フリル
593	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4,5-ジヒドロ-2-フリル
594	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2,3-ジヒドロ-2-フリル
595	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-フリル
596	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4,5-ジヒドロ-3-フリル
597	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2,3-ジヒドロ-3-フリル
598	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-チエニル
599	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4,5-ジヒドロ-2-チエニル
600	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2,3-ジヒドロ-2-チエニル
601	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	5-クロロ-2-チエニル
602	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	5-メチル-2-チエニル
603	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-チエニル
604	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4,5-ジヒドロ-3-チエニル
605	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2,3-ジヒドロ-3-チエニル
606	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-ピロリル
607	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2,5-ジヒドロ-2-ピロリル
608	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-ピロリル
609	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2,5-ジヒドロ-3-ピロリル
610	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-イソオキサゾリル
611	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4-メチル-3-イソオキサゾリル
612	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	5-メチル-3-イソオキサゾリル
613	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4,5-ジメチル-3-イソオキサゾリル
614	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
615	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4-メチル-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
616	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	5-メチル-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
617	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロ-3- イソオキサゾリル
618	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4-イソオキサゾリル
619	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-メチル-4-イソオキサゾリル

【表18】

10

20

30

40

No.	X ¹ *	Het
620	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	5-メチル-4-イソオキサゾリル
621	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	5-シクロプロピル-4-イソオキサゾリル
622	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	5-フェニル-4-イソオキサゾリル
623	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3,5-ジメチル-4-イソオキサゾリル
624	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
625	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-メチル-4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
626	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	5-メチル-4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
627	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3,5-ジメチル-4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
628	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	5-イソオキサゾリル
629	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-メチル-5-イソオキサゾリル
630	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4-メチル-5-イソオキサゾリル
631	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3,4-ジメチル-5-イソオキサゾリル
632	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
633	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-メチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
634	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4-メチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
635	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3,4-ジメチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
636	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-イソチアゾリル
637	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4-メチル-3-イソチアゾリル
638	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	5-メチル-3-イソチアゾリル
639	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4-イソチアゾリル
640	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-メチル-4-イソチアゾリル
641	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	5-メチル-4-イソチアゾリル
642	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	5-イソチアゾリル
643	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-メチル-5-イソチアゾリル
644	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4-メチル-5-イソチアゾリル
645	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-オキサゾリル
646	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4-オキサゾリル
647	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	5-オキサゾリル
648	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-チアゾリル
649	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4-チアゾリル
650	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	5-チアゾリル
651	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-ピラゾリル
652	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4-ピラゾリル
653	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	1-メチル-3-ピラゾリル
654	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	1-メチル-4-ピラゾリル
655	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	1-メチル-5-ピラゾリル
656	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-イミダゾリル

【表19】

No.	X1*	Het
657	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	1-メチル-2-イミダゾリル
658	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	5-メチル- [1, 3, 4] -2-オキサジアゾリル
659	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	5-メチル- [1, 2, 4] -3-オキサジアゾリル
660	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	5-メチル- [1, 3, 4] -2-チアジアゾリル
661	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	5-メチル- [1, 2, 4] -3-チアジアゾリル
662	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	[1, 2, 4] -3-トリアゾリル
663	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	[1, 2, 3] -4-トリアゾリル
664	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-ピリジル
665	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	6-クロロ-2-ピリジル
666	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	6-メトキシ-2-ピリジル
667	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	6-トリフルオロメチル-2-ピリジル
668	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-ピリジル
669	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-クロロ-3-ピリジル
670	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-メトキシ-3-ピリジル
671	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4-ピリジル
672	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-クロロ-4-ピリジル
673	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-メトキシ-4-ピリジル
674	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-エトキシ-4-ピリジル
675	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-メチルチオ-4-ピリジル
676	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-トリフルオロメチル-5-ピリジル
677	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-ピリミジニル
678	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-ピリミジニル
679	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4-ピリミジニル
680	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-ピラジニル
681	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	3-ピリダジニル
682	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4-ピリダジニル
683	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-(2H-1, 3-オキサジニル)
684	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	2-(6H-1, 3-オキサジニル)
685	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	4-(6H-1, 3-オキサジニル)
686	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	6-(6H-1, 3-オキサジニル)
687	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	[1, 3, 5] -2-トリアジニル
688	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	[1, 2, 4] -3-トリアジニル
689	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	[1, 2, 4] -5-トリアジニル
690	CH ₂ OCH ₂ CH=CH	[1, 2, 4] -6-トリアジニル
691	CH=CHCH ₂ O	オキシラニル
692	CH=CHCH ₂ O	3-メチル-2-オキシラニル
693	CH=CHCH ₂ O	2-オキセタニル
694	CH=CHCH ₂ O	3-ヒドロキシ-3-メチル-2-オキセタニル
695	CH=CHCH ₂ O	3-ヒドロキシ-3-エチル-2-オキセタニル

10

20

30

40

【表 20】

No.	X1 *	Het
696	CH=CHCH ₂ O	3-ヒドロキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
697	CH=CHCH ₂ O	3-ヒドロキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
698	CH=CHCH ₂ O	3-メトキシ-3-メチル-2-オキセタニル
699	CH=CHCH ₂ O	3-メトキシ-3-エチル-2-オキセタニル
700	CH=CHCH ₂ O	3-メトキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
701	CH=CHCH ₂ O	3-メトキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
702	CH=CHCH ₂ O	3-トリメチル- シリルオキシ-3-メチル-2-オキセタニル
703	CH=CHCH ₂ O	3-トリメチル- シリルオキシ-3-エチル-2-オキセタニル
704	CH=CHCH ₂ O	3-トリメチル- シリルオキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
705	CH=CHCH ₂ O	3-トリメチル- シリルオキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
706	CH=CHCH ₂ O	3-オキセタニル
707	CH=CHCH ₂ O	2-フリル
708	CH=CHCH ₂ O	4,5-ジヒドロ-2-フリル
709	CH=CHCH ₂ O	2,3-ジヒドロ-2-フリル
710	CH=CHCH ₂ O	3-フリル
711	CH=CHCH ₂ O	4,5-ジヒドロ-3-フリル
712	CH=CHCH ₂ O	2,3-ジヒドロ-3-フリル
713	CH=CHCH ₂ O	2-チエニル
714	CH=CHCH ₂ O	4,5-ジヒドロ-2-チエニル
715	CH=CHCH ₂ O	2,3-ジヒドロ-2-チエニル
716	CH=CHCH ₂ O	5-クロロ-2-チエニル
717	CH=CHCH ₂ O	5-メチル-2-チエニル
718	CH=CHCH ₂ O	3-チエニル
719	CH=CHCH ₂ O	4,5-ジヒドロ-3-チエニル
720	CH=CHCH ₂ O	2,3-ジヒドロ-3-チエニル
721	CH=CHCH ₂ O	2-ピロリル
722	CH=CHCH ₂ O	2,5-ジヒドロ-2-ピロリル
723	CH=CHCH ₂ O	3-ピロリル
724	CH=CHCH ₂ O	2,5-ジヒドロ-3-ピロリル
725	CH=CHCH ₂ O	3-イソオキサゾリル
726	CH=CHCH ₂ O	4-メチル-3-イソオキサゾリル
727	CH=CHCH ₂ O	5-メチル-3-イソオキサゾリル
728	CH=CHCH ₂ O	4,5-ジメチル-3-イソオキサゾリル
729	CH=CHCH ₂ O	4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
730	CH=CHCH ₂ O	4-メチル-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル

10

20

30

40

【表 2 1】

No.	X ¹ *	Het
731	CH=CHCH ₂ O	5-メチル-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
732	CH=CHCH ₂ O	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル
733	CH=CHCH ₂ O	4-イソオキサゾリル
734	CH=CHCH ₂ O	3-メチル-4-イソオキサゾリル
735	CH=CHCH ₂ O	5-メチル-4-イソオキサゾリル
736	CH=CHCH ₂ O	5-シクロプロピル-4-イソオキサゾリル
737	CH=CHCH ₂ O	5-フェニル-4-イソオキサゾリル
738	CH=CHCH ₂ O	3,5-ジメチル-4-イソオキサゾリル
739	CH=CHCH ₂ O	4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
740	CH=CHCH ₂ O	3-メチル-4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
741	CH=CHCH ₂ O	5-メチル-4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
742	CH=CHCH ₂ O	3,5-ジメチル-4,5-ジヒドロ-4-イソオキサゾリル
743	CH=CHCH ₂ O	5-イソオキサゾリル
744	CH=CHCH ₂ O	3-メチル-5-イソオキサゾリル
745	CH=CHCH ₂ O	4-メチル-5-イソオキサゾリル
746	CH=CHCH ₂ O	3,4-ジメチル-5-イソオキサゾリル
747	CH=CHCH ₂ O	4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
748	CH=CHCH ₂ O	3-メチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
749	CH=CHCH ₂ O	4-メチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
750	CH=CHCH ₂ O	3,4-ジメチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
751	CH=CHCH ₂ O	3-イソチアゾリル
752	CH=CHCH ₂ O	4-メチル-3-イソチアゾリル
753	CH=CHCH ₂ O	5-メチル-3-イソチアゾリル
754	CH=CHCH ₂ O	4-イソチアゾリル
755	CH=CHCH ₂ O	3-メチル-4-イソチアゾリル
756	CH=CHCH ₂ O	5-メチル-4-イソチアゾリル
757	CH=CHCH ₂ O	5-イソチアゾリル
758	CH=CHCH ₂ O	3-メチル-5-イソチアゾリル
759	CH=CHCH ₂ O	4-メチル-5-イソチアゾリル
760	CH=CHCH ₂ O	2-オキサゾリル
761	CH=CHCH ₂ O	4-オキサゾリル
762	CH=CHCH ₂ O	5-オキサゾリル
763	CH=CHCH ₂ O	2-チアゾリル
764	CH=CHCH ₂ O	4-チアゾリル
765	CH=CHCH ₂ O	5-チアゾリル
766	CH=CHCH ₂ O	3-ピラゾリル

【表 2 2】

No.	X ¹ *	Het
767	CH=CHCH ₂ O	4-ピラゾリル
768	CH=CHCH ₂ O	1-メチル-3-ピラゾリル
769	CH=CHCH ₂ O	1-メチル-4-ピラゾリル
770	CH=CHCH ₂ O	1-メチル-5-ピラゾリル
771	CH=CHCH ₂ O	2-イミダゾリル
772	CH=CHCH ₂ O	1-メチル-2-イミダゾリル
773	CH=CHCH ₂ O	5-メチル- [1, 3, 4] -2-オキサジアゾリル
774	CH=CHCH ₂ O	5-メチル- [1, 2, 4] -3-オキサジアゾリル
775	CH=CHCH ₂ O	5-メチル- [1, 3, 4] -2-チアジアゾリル
776	CH=CHCH ₂ O	5-メチル- [1, 2, 4] -3-チアジアゾリル
777	CH=CHCH ₂ O	[1, 2, 4] -3-トリアゾリル
778	CH=CHCH ₂ O	[1, 2, 3] -4-トリアゾリル
779	CH=CHCH ₂ O	2-ピリジル
780	CH=CHCH ₂ O	6-クロロ-2-ピリジル
781	CH=CHCH ₂ O	6-メトキシ-2-ピリジル
782	CH=CHCH ₂ O	6-トリフルオロメチル-2-ピリジル
783	CH=CHCH ₂ O	3-ピリジル
784	CH=CHCH ₂ O	2-クロロ-3-ピリジル
785	CH=CHCH ₂ O	2-メトキシ-3-ピリジル
786	CH=CHCH ₂ O	4-ピリジル
787	CH=CHCH ₂ O	2-クロロ-4-ピリジル
788	CH=CHCH ₂ O	2-メトキシ-4-ピリジル
789	CH=CHCH ₂ O	2-エトキシ-4-ピリジル
790	CH=CHCH ₂ O	2-メチルチオ-4-ピリジル
791	CH=CHCH ₂ O	2-トリフルオロメチル-5-ピリジル
792	CH=CHCH ₂ O	2-ピリミジニル
793	CH=CHCH ₂ O	3-ピリミジニル
794	CH=CHCH ₂ O	4-ピリミジニル
795	CH=CHCH ₂ O	2-ピラジニル
796	CH=CHCH ₂ O	3-ピリダジニル
797	CH=CHCH ₂ O	4-ピリダジニル
798	CH=CHCH ₂ O	2-(2H-1, 3-オキサジニル)
799	CH=CHCH ₂ O	2-(6H-1, 3-オキサジニル)
800	CH=CHCH ₂ O	4-(6H-1, 3-オキサジニル)
801	CH=CHCH ₂ O	6-(6H-1, 3-オキサジニル)
802	CH=CHCH ₂ O	[1, 3, 5] -2-トリアジニル
803	CH=CHCH ₂ O	[1, 2, 4] -3-トリアジニル
804	CH=CHCH ₂ O	[1, 2, 4] -5-トリアジニル
805	CH=CHCH ₂ O	[1, 2, 4] -6-トリアジニル

【表 2 3】

10

20

30

40

No.	X ¹ *	Het
806	$C\equiv C-CH_2O$	オキシラニル
807	$C\equiv C-CH_2O$	3-メチル-2-オキシラニル
808	$C\equiv C-CH_2O$	2-オキセタニル
809	$C\equiv C-CH_2O$	3-ヒドロキシ-3-メチル-2-オキセタニル
810	$C\equiv C-CH_2O$	3-ヒドロキシ-3-エチル-2-オキセタニル
811	$C\equiv C-CH_2O$	3-ヒドロキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
812	$C\equiv C-CH_2O$	3-ヒドロキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
813	$C\equiv C-CH_2O$	3-メトキシ-3-メチル-2-オキセタニル
814	$C\equiv C-CH_2O$	3-メトキシ-3-エチル-2-オキセタニル
815	$C\equiv C-CH_2O$	3-メトキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
816	$C\equiv C-CH_2O$	3-メトキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
817	$C\equiv C-CH_2O$	3-トリメチル- シリルオキシ-3-メチル-2-オキセタニル
818	$C\equiv C-CH_2O$	3-トリメチル- シリルオキシ-3-エチル-2-オキセタニル
819	$C\equiv C-CH_2O$	3-トリメチル- シリルオキシ-3-プロピル-2-オキセタニル
820	$C\equiv C-CH_2O$	3-トリメチル- シリルオキシ-3-ブチル-2-オキセタニル
821	$C\equiv C-CH_2O$	3-オキセタニル
822	$C\equiv C-CH_2O$	2-フリル
823	$C\equiv C-CH_2O$	4,5-ジヒドロ-2-フリル
824	$C\equiv C-CH_2O$	2,3-ジヒドロ-2-フリル
825	$C\equiv C-CH_2O$	3-フリル
826	$C\equiv C-CH_2O$	4,5-ジヒドロ-3-フリル
827	$C\equiv C-CH_2O$	2,3-ジヒドロ-3-フリル
828	$C\equiv C-CH_2O$	2-チエニル
829	$C\equiv C-CH_2O$	4,5-ジヒドロ-2-チエニル
830	$C\equiv C-CH_2O$	2,3-ジヒドロ-2-チエニル
831	$C\equiv C-CH_2O$	5-クロロ-2-チエニル
832	$C\equiv C-CH_2O$	5-メチル-2-チエニル

10

20

30

40

【表 2 4】

No.	X ^{1*}	Het
833	$C\equiv C-CH_2O$	3-チエニル
834	$C\equiv C-CH_2O$	4,5-ジヒドロ-3-チエニル
835	$C\equiv C-CH_2O$	2,3-ジヒドロ-3-チエニル
836	$C\equiv C-CH_2O$	2-ピロリル
837	$C\equiv C-CH_2O$	2,5-ジヒドロ-2-ピロリル
838	$C\equiv C-CH_2O$	3-ピロリル
839	$C\equiv C-CH_2O$	2,5-ジヒドロ-3-ピロリル
840	$C\equiv C-CH_2O$	3-イソキサゾリル
841	$C\equiv C-CH_2O$	4-メチル-3-イソキサゾリル
842	$C\equiv C-CH_2O$	5-メチル-3-イソキサゾリル
843	$C\equiv C-CH_2O$	4,5-ジメチル-3-イソキサゾリル
844	$C\equiv C-CH_2O$	4,5-ジヒドロ-3-イソキサゾリル
845	$C\equiv C-CH_2O$	4-メチル-4,5-ジヒドロ-3-イソキサゾリル
846	$C\equiv C-CH_2O$	5-メチル-4,5-ジヒドロ-3-イソキサゾリル
847	$C\equiv C-CH_2O$	4,5-ジメチル-4,5-ジヒドロ-3-イソキサゾリル
848	$C\equiv C-CH_2O$	4-イソキサゾリル
849	$C\equiv C-CH_2O$	3-メチル-4-イソキサゾリル
850	$C\equiv C-CH_2O$	5-メチル-4-イソキサゾリル
851	$C\equiv C-CH_2O$	5-シクロプロピル-4-イソキサゾリル
852	$C\equiv C-CH_2O$	5-フェニル-4-イソキサゾリル
853	$C\equiv C-CH_2O$	3,5-ジメチル-4-イソキサゾリル
854	$C\equiv C-CH_2O$	4,5-ジヒドロ-4-イソキサゾリル
855	$C\equiv C-CH_2O$	3-メチル-4,5-ジヒドロ-4-イソキサゾリル
856	$C\equiv C-CH_2O$	5-メチル-4,5-ジヒドロ-4-イソキサゾリル
857	$C\equiv C-CH_2O$	3,5-ジメチル-4,5-ジヒドロ-4-イソキサゾリル
858	$C\equiv C-CH_2O$	5-イソキサゾリル
859	$C\equiv C-CH_2O$	3-メチル-5-イソキサゾリル
860	$C\equiv C-CH_2O$	4-メチル-5-イソキサゾリル

【表 25】

10

20

30

40

No.	X ¹ *	Het
861	C≡C-CH ₂ O	3,4-ジメチル-5-イソオキサゾリル
862	C≡C-CH ₂ O	4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
863	C≡C-CH ₂ O	3-メチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
864	C≡C-CH ₂ O	4-メチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
865	C≡C-CH ₂ O	3,4-ジメチル-4,5-ジヒドロ-5-イソオキサゾリル
866	C≡C-CH ₂ O	3-イソチアゾリル
867	C≡C-CH ₂ O	4-メチル-3-イソチアゾリル
868	C≡C-CH ₂ O	5-メチル-3-イソチアゾリル
869	C≡C-CH ₂ O	4-イソチアゾリル
870	C≡C-CH ₂ O	3-メチル-4-イソチアゾリル
871	C≡C-CH ₂ O	5-メチル-4-イソチアゾリル
872	C≡C-CH ₂ O	5-イソチアゾリル
873	C≡C-CH ₂ O	3-メチル-5-イソチアゾリル
874	C≡C-CH ₂ O	4-メチル-5-イソチアゾリル
875	C≡C-CH ₂ O	2-オキサゾリル
876	C≡C-CH ₂ O	4-オキサゾリル
877	C≡C-CH ₂ O	5-オキサゾリル
878	C≡C-CH ₂ O	2-チアゾリル
879	C≡C-CH ₂ O	4-チアゾリル
880	C≡C-CH ₂ O	5-チアゾリル
881	C≡C-CH ₂ O	3-ピラゾリル
882	C≡C-CH ₂ O	4-ピラゾリル
883	C≡C-CH ₂ O	1-メチル-3-ピラゾリル
884	C≡C-CH ₂ O	1-メチル-4-ピラゾリル
885	C≡C-CH ₂ O	1-メチル-5-ピラゾリル
886	C≡C-CH ₂ O	2-イミダゾリル
887	C≡C-CH ₂ O	1-メチル-2-イミダゾリル
888	C≡C-CH ₂ O	5-メチル- [1, 3, 4] -2-オキサジアゾリル
889	C≡C-CH ₂ O	5-メチル- [1, 2, 4] -3-オキサジアゾリル

10

20

30

40

【表 2 6】

No.	X ¹ *	Het
890	C≡C-CH ₂ O	5-メチル- [1, 3, 4] -2-チアジアゾリル
891	C≡C-CH ₂ O	5-メチル- [1, 2, 4] -3-チアジアゾリル
892	C≡C-CH ₂ O	[1, 2, 4] -3-トリアゾリル
893	C≡C-CH ₂ O	[1, 2, 3] -3-トリアゾリル
894	C≡C-CH ₂ O	2-ピリジル
895	C≡C-CH ₂ O	6-クロロ-2-ピリジル
896	C≡C-CH ₂ O	6-メトキシ-2-ピリジル
897	C≡C-CH ₂ O	6-トリフルオロメチル-2-ピリジル
898	C≡C-CH ₂ O	3-ピリジル
899	C≡C-CH ₂ O	2-クロロ-3-ピリジル
900	C≡C-CH ₂ O	2-メトキシ-3-ピリジル
901	C≡C-CH ₂ O	4-ピリジル
902	C≡C-CH ₂ O	2-クロロ-4-ピリジル
903	C≡C-CH ₂ O	2-メトキシ-4-ピリジル
904	C≡C-CH ₂ O	2-エトキシ-4-ピリジル
905	C≡C-CH ₂ O	2-メチルチオ-4-ピリジル
906	C≡C-CH ₂ O	2-トリフルオロメチル-5-ピリジル
907	C≡C-CH ₂ O	2-ピリミジニル
908	C≡C-CH ₂ O	3-ピリミジニル
909	C≡C-CH ₂ O	4-ピリミジニル
910	C≡C-CH ₂ O	2-ピラジニル
911	C≡C-CH ₂ O	3-ピリダジニル
912	C≡C-CH ₂ O	4-ピリダジニル
913	C≡C-CH ₂ O	2-(2H-1, 3-オキサジニル)
914	C≡C-CH ₂ O	2-(6H-1, 3-オキサジニル)
915	C≡C-CH ₂ O	4-(6H-1, 3-オキサジニル)
916	C≡C-CH ₂ O	6-(6H-1, 3-オキサジニル)
917	C≡C-CH ₂ O	[1, 3, 5] -2-トリアジニル
918	C≡C-CH ₂ O	[1, 2, 4] -3-トリアジニル

【表 27】

No.	X ¹ *	Het
919	C≡C-CH ₂ O	[1, 2, 4] -5-トリアジニル
920	C≡C-CH ₂ O	[1, 2, 4] -6-トリアジニル

* ブリッジX¹は、左端に中心となるフェニル基があり、右端にH e tがある位置で結合する。

【0072】

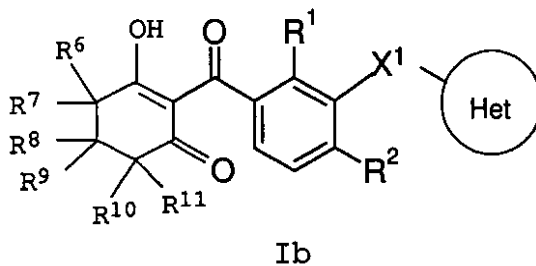
下記の表1～36は、式Ibで表される2-ベンゾイルシクロヘキサン-1,3-ジオン

10

に基づくものである。

【0073】

【化16】



20

表1：化合物1.1～1.920

R¹が塩素、R²がメチルスルホニル、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰及びR¹¹がそれぞれ水素であり、そして個々の化合物について、置換基X¹及びH e tが表Aの各行に対応する式Ibで表される化合物。

【0074】

表2：化合物2.1～2.920

R¹及びR²がそれぞれ塩素、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰及びR¹¹がそれぞれ水素であり、そして個々の化合物について、置換基X¹及びH e tが表Aの各行に対応する式Ibで表

30

される化合物。

【0075】

表3：化合物3.1～3.920

R¹が塩素、R²がトリフルオロメチル、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰及びR¹¹がそれぞれ水素であり、そして個々の化合物について、置換基X¹及びH e tが表Aの各行に対応する式Ibで表される化合物。

【0076】

表4：化合物4.1～4.920

R¹がメチル、R²が塩素、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰及びR¹¹がそれぞれ水素であり、そして個々の化合物について、置換基X¹及びH e tが表Aの各行に対応する式Ibで表

40

される化合物。

【0077】

表5：化合物5.1～5.920

R¹がメチル、R²がメチルスルホニル、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰及びR¹¹がそれぞれ水素であり、そして個々の化合物について、置換基X¹及びH e tが表Aの各行に対応する式Ibで表される化合物。

【0078】

表6：化合物6.1～6.920

R¹がメチル、R²がトリフルオロメチル、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰及びR¹¹がそれぞれ水素であり、そして個々の化合物について、置換基X¹及びH e tが表Aの各行に対応す

50

る式 I b で表される化合物。

【 0 0 7 9 】

表 7 : 化合物 7 . 1 ~ 7 . 9 2 0

R¹ が塩素、R² がメチルスルホニル、R⁶、R⁷、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれ水素、R⁸ 及び R⁹ がそれぞれメチルであり、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に対応する式 I b で表される化合物。

【 0 0 8 0 】

表 8 : 化合物 8 . 1 ~ 8 . 9 2 0

R¹ 及び R² がそれぞれ塩素、R⁶、R⁷、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれ水素、R⁸ 及び R⁹ がそれぞれメチルであり、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に

10

【 0 0 8 1 】

表 9 : 化合物 9 . 1 ~ 9 . 9 2 0

R¹ が塩素、R² がトリフルオロメチル、R⁶、R⁷、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれ水素、R⁸ 及び R⁹ がそれぞれメチルであり、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に対応する式 I b で表される化合物。

【 0 0 8 2 】

表 1 0 : 化合物 1 0 . 1 ~ 1 0 . 9 2 0

R¹ がメチル、R² が塩素、R⁶、R⁷、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれ水素、R⁸ 及び R⁹ がそれぞれメチルであり、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に

20

【 0 0 8 3 】

表 1 1 : 化合物 1 1 . 1 ~ 1 1 . 9 2 0

R¹ がメチル、R² がメチルスルホニル、R⁶、R⁷、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれ水素、R⁸ 及び R⁹ がそれぞれメチルであり、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に対応する式 I b で表される化合物。

【 0 0 8 4 】

表 1 2 : 化合物 1 2 . 1 ~ 1 2 . 9 2 0

R¹ がメチル、R² がトリフルオロメチル、R⁶、R⁷、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれ水素、R⁸ 及び R⁹ がそれぞれメチルであり、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に対応する式 I b で表される化合物。

30

【 0 0 8 5 】

表 1 3 : 化合物 1 3 . 1 ~ 1 3 . 9 2 0

R¹ が塩素、R² がメチルスルホニル、R⁶、R⁷、R⁸ 及び R⁹ がそれぞれ水素、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれメチルであり、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に対応する式 I b で表される化合物。

【 0 0 8 6 】

表 1 4 : 化合物 1 4 . 1 ~ 1 4 . 9 2 0

R¹ 及び R² がそれぞれ塩素、R⁶、R⁷、R⁸ 及び R⁹ がそれぞれ水素、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれメチルであり、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に

40

【 0 0 8 7 】

表 1 5 : 化合物 1 5 . 1 ~ 1 5 . 9 2 0

R¹ が塩素、R² がトリフルオロメチル、R⁶、R⁷、R⁸ 及び R⁹ がそれぞれ水素、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれメチルであり、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に対応する式 I b で表される化合物。

【 0 0 8 8 】

表 1 6 : 化合物 1 6 . 1 ~ 1 6 . 9 2 0

R¹ がメチル、R² が塩素、R⁶、R⁷、R⁸ 及び R⁹ がそれぞれ水素、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれメチルであり、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に

50

応する式 I b で表される化合物。

【 0 0 8 9 】

表 1 7 : 化合物 1 7 . 1 ~ 1 7 . 9 2 0

R¹ がメチル、R² がメチルスルホニル、R⁶、R⁷、R⁸ 及び R⁹ がそれぞれ水素、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれメチルであり、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に対応する式 I b で表される化合物。

【 0 0 9 0 】

表 1 8 : 化合物 1 8 . 1 ~ 1 8 . 9 2 0

R¹ がメチル、R² がトリフルオロメチル、R⁶、R⁷、R⁸ 及び R⁹ がそれぞれ水素、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれメチルであり、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に対応する式 I b で表される化合物。

10

【 0 0 9 1 】

表 1 9 : 化合物 1 9 . 1 ~ 1 9 . 9 2 0

R¹ が塩素、R² がメチルスルホニル、R⁶、R⁷、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれメチルを表し、C R⁸ R⁹ 単位が基 C = O を形成し、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に対応する式 I b で表される化合物。

【 0 0 9 2 】

表 2 0 : 化合物 2 0 . 1 ~ 2 0 . 9 2 0

R¹ 及び R² がそれぞれ塩素、R⁶、R⁷、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれメチルを表し、C R⁸ R⁹ 単位が基 C = O を形成し、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に対応する式 I b で表される化合物。

20

【 0 0 9 3 】

表 2 1 : 化合物 2 1 . 1 ~ 2 1 . 9 2 0

R¹ が塩素、R² がトリフルオロメチル、R⁶、R⁷、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれメチルを表し、C R⁸ R⁹ 単位が基 C = O を形成し、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に対応する式 I b で表される化合物。

【 0 0 9 4 】

表 2 2 : 化合物 2 2 . 1 ~ 2 2 . 9 2 0

R¹ がメチル、R² が塩素、R⁶、R⁷、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれメチルを表し、C R⁸ R⁹ 単位が基 C = O を形成し、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に対応する式 I b で表される化合物。

30

【 0 0 9 5 】

表 2 3 : 化合物 2 3 . 1 ~ 2 3 . 9 2 0

R¹ がメチル、R² がメチルスルホニル、R⁶、R⁷、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれメチルを表し、C R⁸ R⁹ 単位が基 C = O を形成し、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に対応する式 I b で表される化合物。

【 0 0 9 6 】

表 2 4 : 化合物 2 4 . 1 ~ 2 4 . 9 2 0

R¹ がメチル、R² がトリフルオロメチル、R⁶、R⁷、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれメチルを表し、C R⁸ R⁹ 単位が基 C = O を形成し、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に対応する式 I b で表される化合物。

40

【 0 0 9 7 】

表 2 5 : 化合物 2 5 . 1 ~ 2 5 . 9 2 0

R¹ がメチルスルホニル、R⁶、R⁷、R⁸、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれ水素、R⁹ がメチルであり、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に対応する式 I b で表される化合物。

【 0 0 9 8 】

表 2 6 : 化合物 2 6 . 1 ~ 2 6 . 9 2 0

R¹ 及び R² がそれぞれ塩素、R⁶、R⁷、R⁸、R¹⁰ 及び R¹¹ がそれぞれ水素、R⁹ がメチルであり、そして個々の化合物について、置換基 X¹ 及び H e t が表 A の各行に対応する式

50

I bで表される化合物。

【0099】

表27：化合物27.1～27.920

R¹が塩素、R²がトリフルオロメチル、R⁶、R⁷、R⁸、R¹⁰及びR¹¹がそれぞれ水素、R⁹がメチルであり、そして個々の化合物について、置換基X¹及びH e tが表Aの各行に対応する式I bで表される化合物。

【0100】

表28：化合物28.1～28.920

R¹がメチル、R²が塩素、R⁶、R⁷、R⁸、R¹⁰及びR¹¹がそれぞれ水素、R⁹がメチルであり、そして個々の化合物について、置換基X¹及びH e tが表Aの各行に対応する式I bで表される化合物。

10

【0101】

表29：化合物29.1～29.920

R¹がメチル、R²がメチルスルホニル、R⁶、R⁷、R⁸、R¹⁰及びR¹¹がそれぞれ水素、R⁹がメチルであり、そして個々の化合物について、置換基X¹及びH e tが表Aの各行に対応する式I bで表される化合物。

【0102】

表30：化合物30.1～30.920

R¹がメチル、R²がトリフルオロメチル、R⁶、R⁷、R⁸、R¹⁰及びR¹¹がそれぞれ水素、R⁹がメチルであり、そして個々の化合物について、置換基X¹及びH e tが表Aの各行に対応する式I bで表される化合物。

20

【0103】

表31：化合物31.1～31.920

R¹が塩素、R²がメチルスルホニル、R⁶、R⁷、R⁹及びR¹⁰がそれぞれ水素を表し、R⁸とR¹¹が合体してメチレン基を形成し、そして個々の化合物について、置換基X¹及びH e tが表Aの各行に対応する式I bで表される化合物。

【0104】

表32：化合物32.1～32.920

R¹及びR²がそれぞれ塩素、R⁶、R⁷、R⁹及びR¹⁰がそれぞれ水素を表し、R⁸とR¹¹が合体してメチレン基を形成し、そして個々の化合物について、置換基X¹及びH e tが表Aの各行に対応する式I bで表される化合物。

30

【0105】

表33：化合物33.1～33.920

R¹が塩素、R²がトリフルオロメチル、R⁶、R⁷、R⁹及びR¹⁰がそれぞれ水素を表し、R⁸とR¹¹が合体してメチレン基を形成し、そして個々の化合物について、置換基X¹及びH e tが表Aの各行に対応する式I bで表される化合物。

【0106】

表34：化合物34.1～34.920

R¹がメチル、R²が塩素、R⁶、R⁷、R⁹及びR¹⁰がそれぞれ水素を表し、R⁸とR¹¹が合体してメチレン基を形成し、そして個々の化合物について、置換基X¹及びH e tが表Aの各行に対応する式I bで表される化合物。

40

【0107】

表35：化合物35.1～35.920

R¹がメチル、R²がメチルスルホニル、R⁶、R⁷、R⁹及びR¹⁰がそれぞれ水素を表し、R⁸とR¹¹が合体してメチレン基を形成し、そして個々の化合物について、置換基X¹及びH e tが表Aの各行に対応する式I bで表される化合物。

【0108】

表36：化合物36.1～36.920

R¹がメチル、R²がトリフルオロメチル、R⁶、R⁷、R⁹及びR¹⁰がそれぞれ水素を表し、R⁸とR¹¹が合体してメチレン基を形成し、そして個々の化合物について、置換基X¹及

50

びHetが表Aの各行に対応する式Ibで表される化合物。

【0109】

化合物I及びその農業上有用な塩は、異性体混合物、また純粋な異性体の形態で、除草剤として好適である。Iを含む除草剤組成物は、非栽培領域の植生の制御に、特に高い施与率で効果的である。これらの組成物は、オオムギ、米、トウモロコシ、大豆、及び綿花等の作物の中に広範囲に残った雑草及び牧草に対して、栽培植物に損傷を与えることなく作用する。この効果は、主に低施与率で観察される。

【0110】

施与方法の相違によるが、化合物I又はこれらを含む組成物は、更に多くの栽培植物に、望ましくない植物の除去のために使用することができる。適当な作物として以下のものを挙げる事ができる：

タマネギ (*Allium cepa*)

パイナップル (*Ananas comosus*)

ナンキンマメ (*Arachis hypogaea*)

アスパラガス (*Asparagus officinalis*)

フダンソウ (*Beta vulgaris* spp. *altissima*)

サトウジシャ (*Beta vulgaris* spp. *rapa*)

アブラナ (変種カブラ) (*Brassica napus* var. *napus*)

カブカンラン (変種ナポブラシーカ) (*Brassica napus* var. *napobrassica*)

テンサイ (変種シルベストリス) (*Brassica rapa* var. *silvestris*)

トウツバキ (*Camellia sinensis*)

ベニバナ (*Carthamus tinctorius*)

キヤリーヤイリノイネンシス (*Carya illinoensis*)

レモン (*Citrus limon*)

ナツミカン (*Citrus sinensis*)

コーヒー [*Coffea arabica* (*Coffea canephora*, *Coffea liberica*)]

キュウリ (*Cucumis sativus*)

ギョウギシバ (*Cynodon dactylon*)

ニンジン (*Daucus carota*)

アブラヤシ (*Elaeis guineensis*)

イチゴ (*Fragaria vesca*)

大豆 (*Glycine max*)

木棉 [*Gossypium hirsutum* (*Gossypium arboreum*, *Gossypium herbaceum*, *Gossypium vitifolium*)]

ヒマワリ (*Helianthus annuus*)

ゴムノキ (*Hevea brasiliensis*)

大麦 (*Hordeum vulgare*)

カラハナソウ (*Humulus lupulus*)

アメリカイモ (*Ipomoea batatas*)

オニグルミ (*Juglans regia*)

レンズマメ (*Lens culinaris*)

アマ (*Linum usitatissimum*)

トマト (*Lycopersicon lycopersicum*)

リンゴ属 (*Malus spec.*)

キヤツサバ (*Manihot esculenta*)

ムラサキウマゴヤシ (*Medicago sativa*)

10

20

30

40

50

バシヨウ属 (*Musa spec.*)
 タバコ [*Nicotiana tabacum (N. rustica)*]
 オリーブ (*Olea europaea*)
 イネ (*Oryza sativa*)
 アズキ (*Phaseolus lunatus*)
 ゴガツササゲ (*Phaseolus vulgaris*)
 トウヒ (*Picea abies*)
 マツ属 (*Pinus spec.*)
 シロエンドウ (*Pisum sativum*)
 サクラ (*Prunus avium*) 10
 モモ (*Prunus persica*)
 ナシ (*Pyrus communis*)
 スグリ (*Ribes sylvestri*)
 トウゴマ (*Ricinus communis*)
 サトウキビ (*Saccharum officinarum*)
 ライムギ (*Secale cereale*)
 ジャガイモ (*Solanum tuberosum*)
 モロコシ [*Sorghum bicolor (s. vulgare)*]
 カカオ (*Theobroma cacao*)
 ムラサキツメクサ (*Trifolium pratense*) 20
 小麦 (*Triticum aestivum*)
 トリテイカム、ドラム (*Triticum durum*)
 ソラマメ (*Vicia faba*)
 ブドウ (*Vitis vinifera*)
 トウモロコシ (*Zea mays*)。

更に、遺伝子工学的方法を含む栽培の結果として除草剤の作用に耐性を有する農作物においても化合物 I を使用することができる。

【 0 1 1 1 】

除草剤組成物又は有効成分は、事前法または事後法により施与される。有効成分にある種の栽培植物がほとんど耐性を示さない場合、下部に成長している望ましくない植物の葉又は露出している土壌には付着しても、敏感な栽培植物の葉にできるだけ接触しないように、噴霧装置により除草剤を噴霧することができる（後直接撒布、レイ - バイ）。 30

【 0 1 1 2 】

化合物 I 又はこれらを含む除草剤組成物は、例えば直ぐに噴霧可能な水溶液、粉末、懸濁液、高濃度の水性、油性または他の懸濁液または分散液、エマルジョン、油性分散液、ペースト、ダスト剤、散布剤または顆粒の形で、噴霧、ミスト法、ダスト法、散布法または注入法によって施与することができる。施与方法は、使用目的に基づいて決定される。いずれの場合にも、本発明の有効物質の可能な限りの微細分配が保証されるべきである。

【 0 1 1 3 】

好適な不活性添加剤としては、本質的に下記のものである：中位乃至高位の沸点の鉱油留分（例えば燈油またはディーゼル油、更にコールタール油等）、並びに植物性または動物性産出源の油、脂肪族、環式および芳香族炭化水素（例えばパラフィン、テトラヒドロナフタリン、アルキル置換ナフタリン又はその誘導体、アルキル置換ベンゼン又はその誘導体）、アルコール（例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、シクロヘキサノール）、ケトン（例えば、シクロヘキサノン）、高極性溶剤（例えば、N - メチルピロリドン等のアミン、水）。 40

【 0 1 1 4 】

水性使用形態は、乳濁液濃縮物、懸濁液、ペースト、湿潤可能な粉末または水分散可能な粉末から水の添加により製造することができる。乳濁液、ペーストまたは油分散液の製造は、置換 2 - ベンゾイルシクロヘキサン - 1 , 3 - ジオンをそのまま、または油または溶 50

剤中に溶解して、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤または乳化剤により水中に均質に混合することにより行うことができる。或いは、有効物質、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤または乳化剤、及び必要により溶剤又は油よりなる濃縮物を製造することもでき、これらは水にて希釈するのに適する。

【0115】

適当な界面活性剤としては次のものが挙げられる：芳香族スルホン酸（例えば、リグニンスルホン酸、フェノールスルホン酸、ナフタリンスルホン酸、ジブチルナフタリンスルホン酸）のアルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩及びアンモニウム塩；脂肪酸、アルキルスルホナート、アルキルアリアルスルホナート、アルキルスルファート、ラウリルエーテルスルファート及び脂肪アルコールスルファートのアルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩及びアンモニウム塩；硫酸化ヘキサデカノール、ヘプタデカノールおよびオクタデカノールの塩；脂肪アルコールグリコールエーテルの塩；スルホン化ナフタリン及びその誘導体とホルムアルデヒドとの縮合生成物、ナフタリン或いはナフタリンスルホン酸とフェノール及びホルムアルデヒドとの縮合生成物、ポリオキシエチレンオクチルフェノールエーテル、エトキシ化イソオクチルフェノール、エトキシ化オクチルフェノール、エトキシ化ノニルフェノール、アルキルフェニルポリグリコールエーテル、トリブチルフェニルポリグリコールエーテル、アルキルアリアルポリエーテルアルコール、イソトリデシルアルコール、脂肪アルコール/エチレンオキシド縮合物、エトキシ化ヒマシ油、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、またはポリオキシプロピレンアルキルエーテル、ラウリルアルコールポリグリコールエーテルアセタート、ソルビットエステル、リグニン - 亜硫酸廃液およびメチルセルロース。

10

20

【0116】

粉末、散布剤およびダスト剤は、有効物質と固体担体物質とを混合または一緒に磨砕することにより製造することができる。

【0117】

粒状体（例えば、被覆粒状体、含浸粒状体及び均質粒状体）は、有効物質を固体担体物質に結合させることにより製造することができる。固体担体物質の例としては、鉱物土（例えば、シリカ、シリカゲル、珪酸塩、タルク、カオリン、石灰石、石灰、白亜、膠塊粒土、石灰質黄色粘土、クレイ、白雲石、珪藻土、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウム、磨砕合成物質）、肥料（例えば、硫酸アンモニウム、燐酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素）及び植物性生成物（例えば、穀物粉、樹皮、木材およびクルミ穀粉、セルロース粉末）、又は他の固形担体物質である。

30

【0118】

直接使用可能な製剤の有効成分 I の濃度は、広い範囲で変更することができる。一般に、その処方は、少なくとも 1 種の有効成分を、0.001 ~ 98 重量%、好ましくは 0.01 ~ 95 重量%の量で含む。有効成分は 90 ~ 100% の純度（NMR スペクトルによる）のもの、好ましくは 95 ~ 100% の純度のものが使用される。

【0119】

本発明の化合物 I の製造を、下記の調製例に示す：

I：20 重量部の化合物 I を、80 重量部のアルキル化ベンゼン、10 重量部の、オレイン酸 N - モノエタノールアミド（1 モル）のエチレンオキシド（8 ~ 10 モル）付加体、5 重量部のドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及び 5 重量部の、ヒマシ油（1 モル）のエチレンオキシド（40 モル）付加体からなる混合物に溶解させる。この溶液を 100000 重量部の水に注ぎ、その中で微細に分散させ、これにより 0.02 重量% の有効成分を含む水性分散液を得る。

40

【0120】

II：20 重量部の化合物 I を、40 重量部のシクロヘキサノン、30 重量部のイソブタノール、20 重量部の、イソオクチルフェノール（1 モル）のエチレンオキシド（7 モル）付加体及び 10 重量部の、ヒマシ油（1 モル）のエチレンオキシド（40 モル）付加体からなる混合物に溶解させる。この溶液を 100000 重量部の水に注ぎ、その中で微細

50

に分散させ、これにより 0.02 重量%の有効成分を含む水性分散液を得る。

【0121】

III：20重量部の化合物Iを、25重量部のシクロヘキサノン、65重量部の鉱物油（沸点210～280の留分）及び10重量部の、ヒマシ油（1モル）のエチレンオキシド（40モル）付加体からなる混合物に溶解させる。この溶液を100000重量部の水に注ぎ、その中で微細に分散させ、これにより0.02重量%の有効成分を含む水性分散液を得る。

【0122】

IV：20重量部の化合物Iを、3重量部のジイソブチルナフタリンスルホン酸ナトリウム、17重量部のリグノスルホン酸のナトリウム塩（亜硫酸廃液から得られる）及び60重量部の微粉末のシリカゲルと完全に混合させ、そしてその混合物をハンマーミルで磨砕する。最後に、この混合物を20000重量部の水に分散させ、これにより0.1重量%の有効成分を含む噴霧混合物を得る。

10

【0123】

V：3重量部の化合物Iを、97重量部の微粉碎カオリンと混合し、これにより3重量%の有効成分を含むダストを得る。

【0124】

VI：20重量部の化合物Iを、2重量部のドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム、8重量部の脂肪アルコールポリグリコールエーテル、2重量部のフェノール/尿素/ホルムアルデヒド縮合物のナトリウム塩及び68重量部のパラフィン鉱物油とまず十分に混合させ、これにより安定な油性分散液を得る。

20

【0125】

VII：1重量部の化合物Iを、70重量部のシクロヘキサノン、20重量部のエトキシ化イソオクチルフェノール及び10重量部のエトキシ化ヒマシ油からなる混合物に溶解させ、これにより安定なエマルジョン濃縮体を得る。

【0126】

VIII：1重量部の化合物Iを、80重量部のシクロヘキサノン及び20重量部のウェットール（登録商標）EM31 (Wettol[®] EM31; エトキシ化ひまし油を基礎とする非イオン乳化剤) からなる混合物に溶解させ、これにより安定なエマルジョン濃縮体を得る。

【0127】

作用範囲を広げ、そして相乗作用を得るために、置換2-ベンゾイルシクロヘキサノン-1,3-ジオンIは、多くの他の代表的なグループの除草剤又は成長調整剤の有効成分と混合することができ、そしてこれらと共に施与することができる。混合に適当な成分としては、例えば1,2,4-チアジアゾール、1,3,4-チアジアゾール、アミド、アミノホスホン酸及びその誘導体、アミノトリアゾール、アニリド、アリール/ヘテロアリーロキシアルカン酸及びその誘導体、安息香酸及びその誘導体、ベンゾチアジアジノン、2-アロイル-1,3-シクロヘキサンジオン、ヘテロアリールアリールケトン、ベンジルイソオキサゾリジノン、メタ-CF₃-フェニル誘導体、カルバメート、キノリンカルボン酸及びその誘導体、クロロアセトアニリド、シクロヘキサノン-1,3-ジオン誘導体、ジアジン、ジクロロプロピオン酸及びその誘導体、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロフラン-3-オン、ジニトロアニリン、ジニトロフェノール、ジフェニルエーテル、ジピリジル、ハロカルボン酸及びその誘導体、尿素、3-フェニルウラシル、イミダゾール、イミダゾリノン、N-フェニル-3,4,5,6-テトラヒドロフタルイミド、オキサジアゾール、オキシラン、フェノール、アリーロキシ-又はヘテロアリーロキシ-フェノキシプロピオン酸エステル、フェニル酢酸及びその誘導体、フェニルプロピオン酸及びその誘導体、ピラゾール、フェニルピラゾール、ピリダジン、ピリジンカルボン酸及びその誘導体、ピリミジルエーテル、スルホンアミド、スルホニル尿素、トリアジン、トリアジノン、トリアジノン、トリアゾールカルボキシアミド及びウラシル、を挙げることができる。

30

40

【0128】

50

さらに化合物Iは、単一、あるいは他の除草剤との組合せたものを、他の栽培植物保護剤、例えば殺虫剤または植物殺菌剤または殺バクテリア剤と共に施与することが有利であり得る。苗栄養不足、希元素欠乏などの症状治癒のために使用されるミネラル塩溶液と混合し得ることことも重要である。植物に無害の油類、油濃縮物類も添加し得る。

【0129】

有効化合物(物質)の施与率は、施与目的、季節、対象の植物および成長段階に応じて、1ヘクタールあたり0.001~3.0kgの有効物質(a.s.)の量、好ましくは0.01~1.0kgの量である。

【0130】

出発材料と生成物の幾つかの合成を、以下に記載する。

10

【0131】

{2-クロロ-3-[(1-メチルピラゾール-5-イル)オキシメチル]-4-メチルスルホニルフェニル}{5,5-ジメチル-1,3-ジオキソ-シクロヘキサ-2-イル}メタノン

工程a: 2-クロロ-3-プロモメチル-4-メチルスルホニル安息香酸メチル80g(0.3モル)の2-クロロ-3-メチル-4-メチルスルホニル安息香酸メチル、54g(0.31モル)のN-プロモスクシンイミド及び1.5gのアゾイソブチロニトリルを、76 で6時間撹拌した。反応混合物をろ過し、そして減圧下に溶剤を除去した。収量: 104g; 融点: 83~85。

【0132】

20

工程b: 2-クロロ-[(1-メチルピラゾール-5-イル)オキシメチル]-4-メチルスルホニル安息香酸メチル

4.3g(44ミリモル)の1-メチル-5-ヒドロキシピラゾール、9.1gの炭酸カリウム及び100mlのテトラヒドロフランを、65 で1時間加熱した。この混合物に、15g(44ミリモル)の2-クロロ-3-プロモメチル-4-メチルスルホニル安息香酸メチル及び150mlのテトラヒドロフランを添加し、40 で4時間加熱した。この混合物を、12時間撹拌し、減圧下に溶剤を除去し、酢酸エチルに溶解し、炭酸水素ナトリウム溶液及び水で洗浄し、乾燥し、そして溶剤を除去した。粗生成物を、シリカゲル上で精製した(溶離液: シクロヘキサン/酢酸エチル=1/1)。収量: 7.6g; 融点70。

30

【0133】

工程c: 2-クロロ-[(1-メチルピラゾール-5-イル)オキシメチル]-4-メチルスルホニル安息香酸

30mlのテトラヒドロフランと30mlの水との混合物中の、6.95g(19ミリモル)の2-クロロ-[(1-メチルピラゾール-5-イル)オキシメチル]-4-メチルスルホニル安息香酸メチルを、0.93gの水酸化リチウムを用いて室温で12時間処理した。10%濃度塩酸を用いて反応混合物のpHを4に調整し、塩化メチレンで抽出した。有機層を乾燥し、溶剤を除去した。収量: 4.3g; 融点197。

【0134】

工程d: {2-クロロ-3-[(1-メチルピラゾール-5-イル)オキシメチル]-4-メチルスルホニルフェニル}{5,5-ジメチル-1,3-ジオキソ-シクロヘキサ-2-イル}メタノン

40

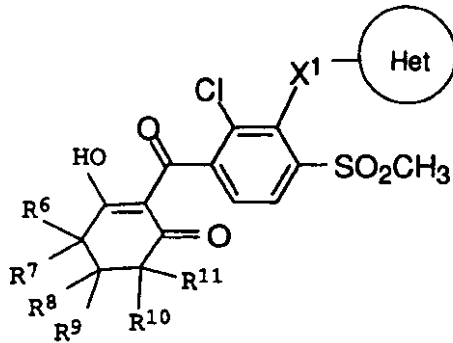
50mlのアセトニトリル中の、1.0g(2.9ミリモル)の2-クロロ-3-[(1-メチルピラゾール-5-イル)オキシメチル]-4-メチルスルホニル安息香酸、0.4g(2.9ミリモル)のジメドン及び0.72gのN,N-ジシクロヘキシルカルボジイミドを、40 で4時間加熱した。反応混合物を室温で12時間撹拌させた後、0.87gのトリエチルアミン及び0.57gのトリメチルシリルニトリルを添加した。その後、反応混合物を40 で6時間加熱し、ろ過し、減圧下に溶剤を除去し、そして残留物をシリカゲル上で精製した(溶離液: トルエン/テトラヒドロフラン/酢酸: 100/0/0~4/1/0.1)。収量: 0.25g; 融点82。

50

【 0 1 3 5 】

【 表 2 8 】

表 37



No.	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X ¹	Het	融点 [°C]	¹ H NMR [ppm]
37.1	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₂ O	1-ピラゾリル	82	
37.2	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₂ O	3,5-ジメチル-1-ピラゾリル	76	
37.3	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₂ O	4-クロロ-1-ピラゾリル	75	
37.4	H	CH ₃	H	H	H	CH ₃	CH ₂ O	3,5-ジメチル-1-ピラゾリル	74	
37.5	H	CH ₃	H	H	H	CH ₃	CH ₂ O	4-クロロ-1-ピラゾリル	79	
37.6	CH ₃	CH ₃	C=O		CH ₃	CH ₃	CH ₂ O	3,5-ジメチル-1-ピラゾリル	137	
37.7	CH ₃	CH ₃	C=O		CH ₃	CH ₃	CH ₂ O	4-クロロ-1-ピラゾリル	95	

【 0 1 3 6 】

[使用実施例]

式 I で表される置換 2 - ベンゾイルシクロヘキサン - 1 , 3 - ジオンの除草作用を下記の温室実験で示した。

【 0 1 3 7 】

プラスチック植木鉢を栽培容器として用い、約 3 . 0 % の腐葉土を含むローム質砂を培養基とした。被検植物の種子を種類ごとに播種した。

【 0 1 3 8 】

事前法 (pre-emergence treatment) により、水中に懸濁または乳化させた有効成分を、種子を撒いた後に微細散布ノズルを使用して直接撒布した。出芽と成長を促進させるために容器を軽く灌水し、次いで植物が根付くまで透明のプラスチックの覆いを被せた。有効成分により害が与えられない限り、この被覆が被検植物の均一な出芽をもたらす。

【 0 1 3 9 】

事後法 (post-emergence treatment) により、被検植物を、発育型によるが、草丈 3 ~ 1 5 c m となった後、水中に懸濁または乳化させた有効成分で処理することのみを行った。この目的のため、被検植物を直接播種し同一の容器で栽培することも、当初は別々に苗として植え、処理の行われる 2 ~ 3 日前に試験用容器に移植することも可能である。

【 0 1 4 0 】

各被検植物を種類により、10～25 または20～35 に保持し、実験期間を2～4週間とした。この間、被検植物を管理し、個々の処理に対する反応を評価した。

【 0 1 4 1 】

0～100の尺度を用いて評価を行った。この尺度において100は植物が全く出芽しないか、或いは少なくとも地上に出ている部分の全てが破壊してしまったことを示し、0は全く被害がなく正常な成長を遂げたことを示す。

フロントページの続き

- (72)発明者 ラインハイマー, ヨーアヒム
ドイツ、D - 6 7 0 6 3、ルートヴィッヒスハーフェン、メルツィガー、シュトラーセ、2 4
- (72)発明者 バウマン, エルンスト
ドイツ、D - 6 7 3 7 3、ドゥーデンハーフェン、ファルケンシュトラーセ、6 アー
- (72)発明者 フォン ダイン, ヴォルフガング
ドイツ、D - 6 7 4 3 5、ノイシュタット、アン、デア、ブライヒェ、2 4
- (72)発明者 ヒル, レジナ, ルイーゼ
ドイツ、D - 6 7 3 4 6、シュパイア、ツィーゲルオーフェンヴェーク、4 0
- (72)発明者 マイア, グイド
ドイツ、D - 6 7 4 3 3、ノイシュタット、グートロイトハウスシュトラーセ、8
- (72)発明者 ミスリッツ, ウルフ
ドイツ、D - 6 7 4 3 3、ノイシュタット、マンデルリング、7 4
- (72)発明者 ヴァーグナー, オリファー
ドイツ、D - 6 7 0 6 1、ルートヴィッヒスハーフェン、ロツシーニシュトラーセ、7
- (72)発明者 ヴィチェル, マティアス
ドイツ、D - 6 7 0 6 1、ルートヴィッヒスハーフェン、ヴィテルスバッハシュトラーセ、8 1
- (72)発明者 オッテン, マルティナ
ドイツ、D - 6 7 0 6 9、ルートヴィッヒスハーフェン、グンターシュトラーセ、2 8
- (72)発明者 ヴァルター, ヘルムート
ドイツ、D - 6 7 2 8 3、オブリッヒハイム、グリューンシュタター、シュトラーセ、8 2
- (72)発明者 ヴェストファレン, カール-オットー
ドイツ、D - 6 7 3 4 6、シュパイア、マウスベルクヴェーク、5 8

審査官 熊谷 祥平

- (56)参考文献 特開平06 - 2 7 1 5 6 2 (J P , A)
特開平06 - 3 2 1 9 3 2 (J P , A)
特開平02 - 0 0 0 2 2 4 (J P , A)
特開昭63 - 2 0 3 6 4 4 (J P , A)
国際公開第96 / 0 1 4 2 8 5 (W O , A 1)
特開平01 - 1 1 7 8 0 3 (J P , A)
特許第0 2 5 9 6 6 3 (J P , B 2)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07D 231/12
C07D 231/16
CAplus(STN)
REGISTRY(STN)