



PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

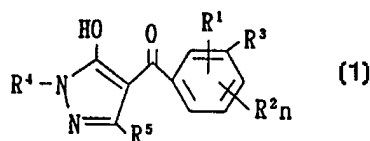
<p>(51) 国際特許分類6 C07D 231/20, A01N 43/56</p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 WO98/56766</p> <p>(43) 国際公開日 1998年12月17日(17.12.98)</p>
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP98/02573</p> <p>(22) 国際出願日 1998年6月11日(11.06.98)</p> <p>(30) 優先権データ 特願平9/171064 1997年6月12日(12.06.97) JP</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 日本曹達株式会社(NIPPON SODA CO., LTD.)(JP/JP) 〒100-8165 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 Tokyo, (JP)</p> <p>(72) 発明者; および</p> <p>(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ) 田中克典(TANAKA, Katsunori)(JP/JP) 阿達弘之(ADACHI, Hiroyuki)(JP/JP) 古口正巳(KOGUCHI, Masami)(JP/JP) 〒250-0280 神奈川県小田原市高田345 日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa, (JP) 川名 貴(KAWANA, Takashi)(JP/JP) 〒421-0412 静岡県榛原郡榛原町坂部62-1 日本曹達株式会社 小田原研究所 榛原研究部内 Shizuoka, (JP)</p>		<p>(74) 代理人 東海裕作(TOKAI, Yusaku) 〒100-8165 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 日本曹達株式会社内 Tokyo, (JP)</p> <p>(81) 指定国 AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, GM, GW, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), ユーランア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p>

(54)Title: BENZOYLPYRAZOLE DERIVATIVES HAVING SPECIFIED SUBSTITUENTS AND HERBICIDES

(54)発明の名称 特定の置換基を有するベンゾイルピラゾール誘導体および除草剤

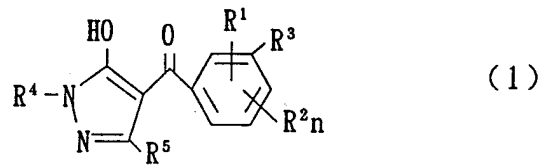
(57) Abstract

Compounds of general formula (1) [wherein R¹ and R² each independently represents halogen, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ alkylsulfonyl or the like; R³ represents formyl or CH(ZR⁶)₂ (in which Z is O or S, and R⁶ is C₁₋₆ alkyl or C₁₋₆ haloalkyl); R⁴ and R⁵ each independently represents hydrogen, C₁₋₆ alkyl, C₂₋₆ alkenyl, C₃₋₈ cycloalkyl or the like; and n represents 1, 2 or 3], salts thereof, and herbicides containing one or more of them.



(57)要約

一般式 (1)



[式中、 R^1 、 R^2 は、それぞれ独立して、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基などを表し、 R^3 は、ホルミル基または $CH(ZR^6)_2$ (Z は、 O または S を、 R^6 は、 C_{1-6} アルキル基または C_{1-6} ハロアルキル基を表す。)を表す。 R^4 、 R^5 は、それぞれ独立して、水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基または C_{3-8} シクロアルキル基などを表し、 n は、1、2、3を表す。]で表される化合物またはその塩、およびこれらの化合物の1種または2種以上を含有する除草剤である。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

AL	アルバニア	FI	フィンランド	LK	スリ・ランカ	SI	スロヴェニア
AM	アルメニア	FR	フランス	LR	リベリア	SK	スロヴァキア
AT	オーストリア	GA	ガボン	LS	レソト	SL	シエラ・レオネ
AU	オーストラリア	GB	英国	LT	リトアニア	SN	セネガル
AZ	アゼルバイジャン	GD	グレナダ	LU	ルクセンブルグ	SZ	スワジランド
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	GE	グルジア	LV	ラトヴィア	TD	チャード
BB	バルバドス	GH	ガーナ	MC	モナコ	TG	トーゴ
BE	ベルギー	GM	ガンビア	MD	モルドヴァ	TJ	タジキスタン
BF	ブルキナ・ファソ	GN	ギニア	MG	マダガスカル	TM	トルクメニスタン
BG	ブルガリア	GW	ギニア・ビサオ	MK	マケドニア旧ユーゴスラヴィア共和国	TR	トルコ
BJ	ベナン	GR	ギリシャ	ML	マリ	TT	トリニダード・トバゴ
BR	ブラジル	HR	クロアチア	MN	モンゴル	UA	ウクライナ
BY	ベラルーシ	HU	ハンガリー	MR	モーリタニア	UG	ウガンダ
CA	カナダ	ID	インドネシア	MW	マラウイ	UZ	ウズベキスタン
CF	中央アフリカ	IE	アイルランド	MX	メキシコ	VN	ヴィエトナム
CG	コンゴ	IL	イスラエル	NE	ニジェール	YU	ユーゴスラヴィア
CH	スイス	IN	インド	NL	オランダ	ZW	ジンバブエ
CI	コートジボアール	IS	アイスランド	NO	ノールウェー		
CM	カメルーン	IT	イタリア	NZ	ニュージーランド		
CN	中国	JP	日本	PL	ポーランド		
CU	キューバ	KE	ケニア	PT	ポルトガル		
CY	キプロス	KG	キルギスタン	RO	ルーマニア		
CZ	チェッコ	KP	北朝鮮	RU	ロシア		
DE	ドイツ	KR	韓国	SD	スーダン		
DK	デンマーク	KZ	カザフスタン	SE	スウェーデン		
EE	エストニア	LC	セントルシア	SG	シンガポール		
ES	スペイン	LI	リヒテンシュタイン				

明 細 書

特定の置換基を有するベンゾイルピラゾール誘導体および除草剤

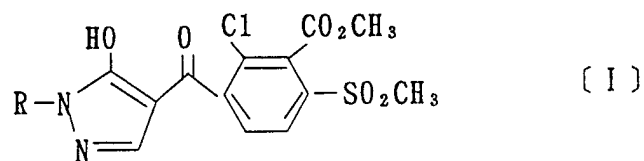
技術分野：

本発明は、新規な、特定の置換基を有するベンゾイルピラゾール誘導体およびそれを有効成分として含有してなる除草剤に関する。

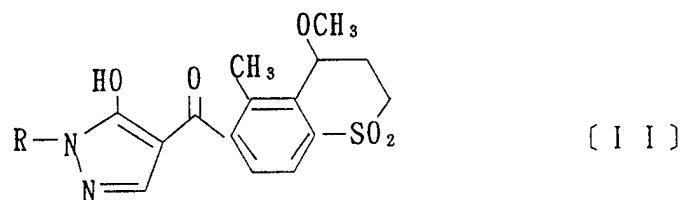
背景技術：

農園芸作物の栽培にあたり、多大の労力を必要としてきた雑草防除に多くの除草剤が使用されるようになってきた。しかし作物に薬害を生じたり、環境に残留したり、汚染したりすることから、より低い薬量で効果が確実でしかも安全に使用できる薬剤の開発が望まれている。

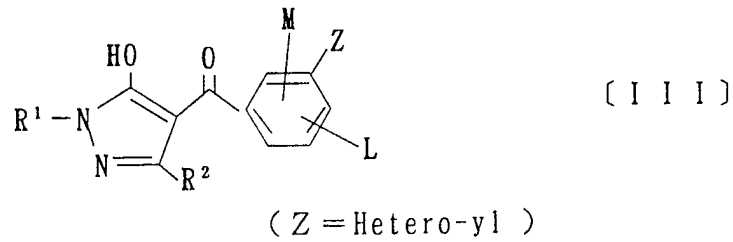
従来、ピラゾール環の4位にベンゾイル基が置換したピラゾール骨格を有する除草剤としては、特開平2-173号公報には、式〔I〕



で表される化合物などが記載され、また、特開平7-309869号公報には、式〔II〕で表される化合物が記載されている。

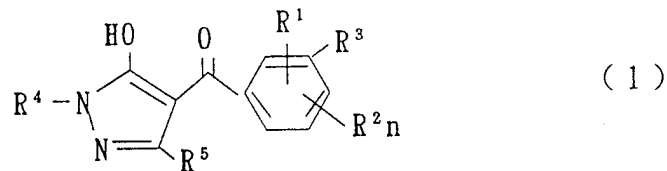


さらに、WO 96/26206号には、式〔III〕で表される化合物が記載されている。



発明の開示：

本発明は、一般式 (I)



[式中、 R^1 、 R^2 は、それぞれ独立して、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} ハロアルキル基、 C_{1-6} ハロアルコキシ基、 C_{1-6} アルキルチオ基、 C_{1-6} アルキルスルフィニル基または C_{1-6} アルキルスルホニル基を示す。

R^3 は、ホルミル基または $CH(ZR^6)_2$ (ここで、 Z は、 O または S を、 R^6 は、 C_{1-6} アルキル基または C_{1-6} ハロアルキル基を示す。)を示す。

R^4 、 R^5 は、それぞれ独立して、水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} ハロアルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基または C_{3-8} シクロアルキル基を示す。

n は、1、2 または 3 を示す。]

で表される化合物またはその塩、それらの 1 種または 2 種以上を有効成分として含有してなる除草剤である。

発明を実施するための形態：

一般式(1)において、 R^1 、 R^2 におけるハロゲン原子としては、塩素、臭素、フッ素などが挙げられる。 C_{1-6} アルキル基としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチルなどが、 C_{1-6} アルコキシ基としては、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、*t*-ブトキシなどが、 C_{1-6} ハロアルキル基としては、フルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、フルオロクロロメチル、トリクロロメチル、トリブromoメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチルなどが、 C_{1-6} ハロアルコキシ基としては、トリフルオロメトキシ、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ、トリクロロメトキシ、ジフルオロメトキシなどが挙げられる。また、 C_{1-6} アルキルチオ基としては、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオなどが、 C_{1-6} アルキルスルフィニル基としては、メチルスルフィニル、エチルスルフィニルなどが、 C_{1-6} アルキルスルホニル基としては、メチルスルホニル、エチルスルホニルなどが挙げられる。

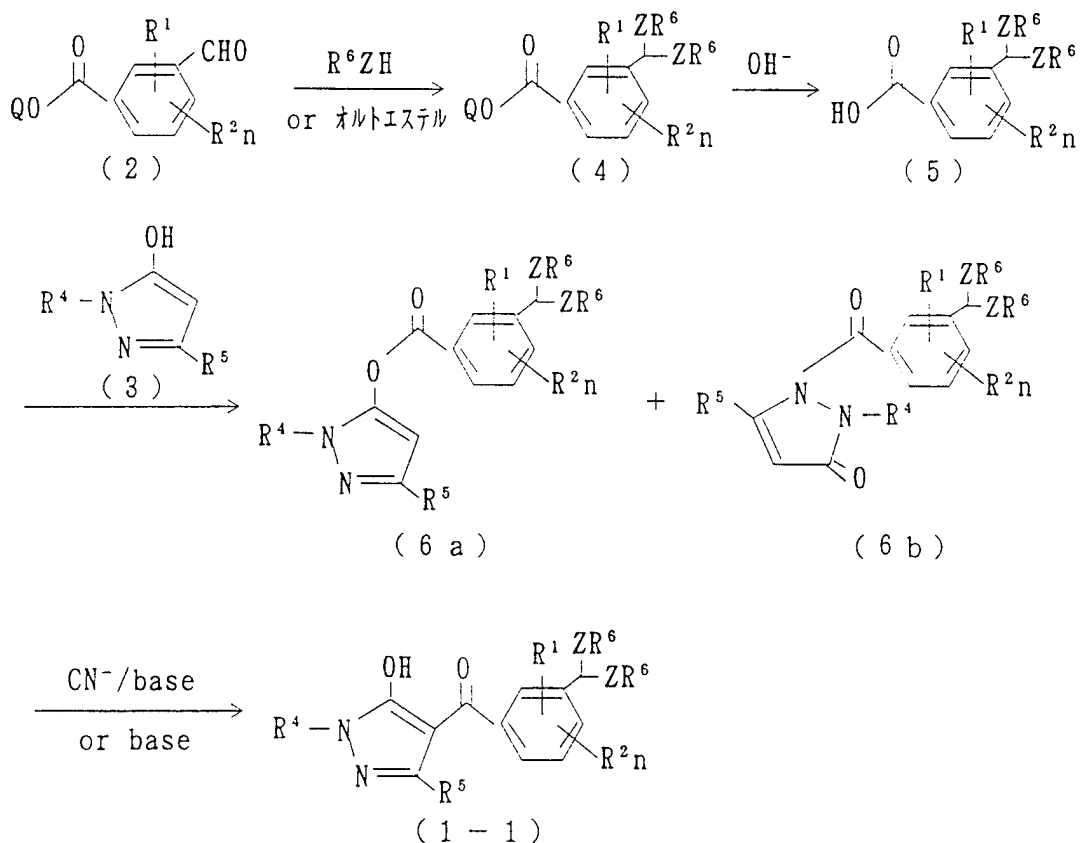
また、 R^4 、 R^5 における C_{1-6} アルキル基としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチルなどが、 C_{1-6} ハロアルキル基としては、フルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、フルオロクロロメチル、トリクロロメチル、トリブromoメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチルなどが、 C_{2-6} アルケニル基としては、ビニル、1-プロペニル、アリル、クロチル、ブタジエニルなどが、 C_{2-6} アルキニル基としては、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル等が、 C_{3-8} シクロアルキル基としては、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシルなどが挙げられる。

さらに、 R^6 における C_{1-6} アルキル基としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチルなどが、 C_{1-6} ハロアルキル基としては、フルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、フルオロクロロメチル、トリクロロメチル、トリブromoメチル、2, 2, 2

ートリフルオロエチル，ペンタフルオロエチルなどが挙げられる。

本発明の化合物は、次の方法によって製造することができる。

製造法 (i)



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 Z および n は、前記と同じ意味を示し、 Q は、低級アルキルを示す。)

上記反応式で示されるように、3-ホルミル安息香酸エステル(2)からアセタール化合物(4)に誘導し、化合物(5)を得たのち、このものをヒドロキシピラゾール(3)と反応させることにより、化合物(6a)および/または化合物(6b)を製造する。次いで、得られた化合物(6a)および/または化合物(6b)を転位反応により、目的物(1-1)を製造することができる。

化合物(4)は、化合物(2)と、メタノール、エタノールなどのアルコール

類、オルトギ酸メチルなどのオルトエステル類、または、メタンチオール、エタンチオールなどのアルカンチオール類とを、1モルずつ、あるいは一方を過剰に使い、例えば、Org. Synth., III, 644 (1955)に記載された方法などの一般の合成化学的手法で製造することができる。

化合物(5)は、化合物(4)を水酸化ナトリウムなどのアルカリを用いた一般の合成化学的手法で製造することができる。

化合物(6a)および(6b)は、化合物(5)と化合物(3)とを、ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)などの脱水縮合剤の存在下に反応させることによって得られる。DCCなどとの反応において用いられる溶媒としては、塩化メチレン、クロロホルム、トルエン、酢酸エチル、ジメチルホルムアミド(DMF)、テトラヒドロフラン(THF)、1,2-ジメトキシエタン、アセトニトリル、t-ペンチルアルコールなどが例示できる。反応混合物は反応が完了するまで-10℃から溶媒の沸点で攪拌され、反応混合物は常法によって後処理される。

化合物(6a)および(6b)は混合物として、そのまま、次の転位反応に使用することができる。

転位反応は、シアン化合物および穏和な塩基の存在下で行われる。すなわち、化合物(6a)および(6b)の1モルを、1~4モルの塩基、好ましくは1~2モルの塩基および0.01モルから1.0モル、好ましくは0.05モルから0.2モルのシアン化合物と反応させることにより、化合物(1-1)を得ることができる。

反応に用いられる塩基としては、KOH、NaOHなどのアルカリ金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムなどのアルカリ金属炭酸塩、水酸化カルシウム、水酸化マグネシウムなどのアルカリ土類金属水酸化物、炭酸カルシウムなどのアルカリ土類金属炭酸塩、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンなどの第三アミン、ピリジンなどの有機塩基、磷酸ナトリウムなどを例示することができる。

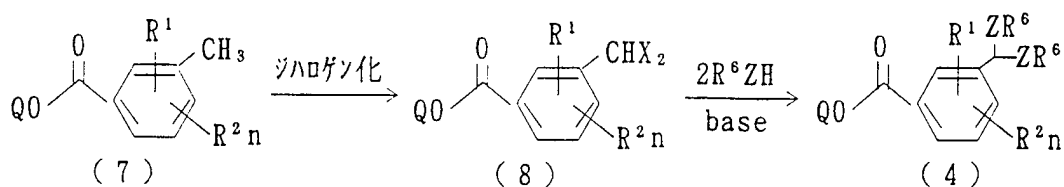
また、シアン化合物としては、シアン化カリウム、シアン化ナトリウム、アセトンシアンヒドリン、シアン化水素、シアン化カリウムを保持したポリマーなど

を挙げることができる。なお、少量のクラウンエーテルなどの相間移動触媒を加えることにより、反応がより短い時間で完結するので好ましい。反応温度は80℃より低い温度、好ましくは室温から40℃で行われる。用いられる溶媒は、トルエン、アセトニトリル、1,2-ジクロロエタン、塩化メチレン、クロロホルム、酢酸エチル、DMF、メチルイソブチルケトン、THF、ジメトキシエタンなどである。

また、この転位反応は、不活性溶媒中、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、トリエチルアミン、ピリジンなどの塩基の存在下に行うこともできる。用いられる塩基の量は、化合物(6a)および(6b)に対して0.5~2.0モルであり、溶媒としては、THF、ジオキサン、*t*-ペンチルアルコール、*t*-ブチルアルコールなどが用いられる。反応温度は、室温から用いる溶媒の沸点までが好ましい。

さらに、化合物(6a)および(6b)を単離することなしに、DCCなどの脱水縮合剤と共に塩基を用いることによっても化合物(1-1)を得ることができる。用いられる塩基としては、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、トリエチルアミン、ピリジンなどであり、用いられる塩基の量は、化合物(3)に対して0.5~2.0モルである。また、溶媒としては、THF、ジオキサン、*t*-ペンチルアルコール、*t*-ブチルアルコールなどであり、反応温度は、室温から用いる溶媒の沸点までが好ましい。

なお、化合物(4)は、例えば、Chem. Ind. (London), 656(1960)などに記載された以下に示す方法によっても製造することができる。

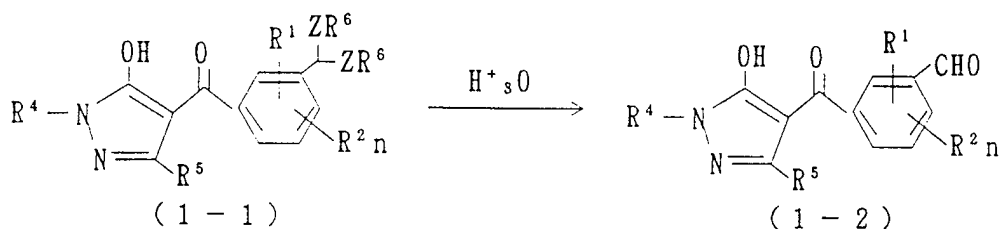


(式中、 R^1 , R^2 , R^6 , Q , Z および n は、前記と同じ意味を示し、 X は、

ハロゲン原子を示す。)

すなわち、トルエン誘導体 (7) に、ハロゲン化剤を反応させ、gem-ジハロゲン化合物 (8) を得た後、 $R^6 ZH$ (式中、 R^6 および Z は、前記と同じ意味を示す。) で表される、アルコール類やチオール類を適当な塩基の存在下で反応させて、化合物 (4) を得るものである。

製造法 (ii)



(式中、 R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , R^6 , Z および n は、前記と同じ意味を示す。)

上記反応式で示されるように、アセタール化合物 (1-1) を、酸を用いて加水分解することにより目的物 (1-2) を製造することができる。

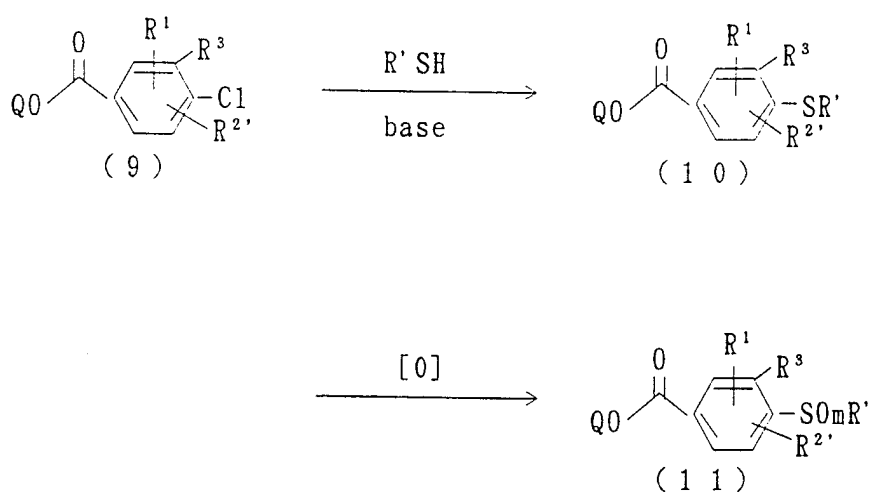
この反応において、用いられる酸としては、塩酸、硫酸などの無機酸類、塩化亜鉛、四塩化チタン、p-トルエンスルホン酸などのルイス酸類、酢酸、トリフルオロ酢酸などの有機塩類などを例示することができる。

また、溶媒としては、水、メタノール、エタノールなどのアルコール類、塩化メチレン、クロロホルムなどのハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエンなどの芳香族炭化水素類、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン類、ジエチルエーテル、THFなどのエーテル類、アセトニトリル、DMFなどが用いられる。

反応混合物は、 -10°C から溶媒の沸点までの温度で攪拌され、反応終了後は、常法により後処理される。

次に、本発明化合物の中間体の製造方法について説明する。

下記式(11)で表される安息香酸類は、式(9)で表される4-C1体に、R'SH(式中、R'は、低級アルキル基を示す。)で表されるアルカンチオールを、塩基の存在下に作用させることによって、式(10)で表される4-SR'体としたのち、酸化することにより製造することができる。SO_mR'(m=1, 2)が4位以外に置換している場合も相当する位置のクロル体から同様にして変換できる。



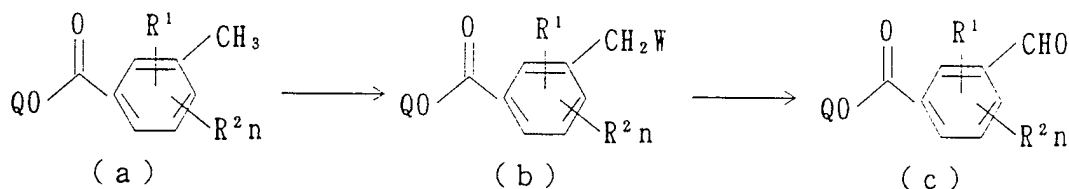
[式中、R¹、R³ およびQは、前記と同じ意味を示し、R^{2'}は、R²ⁿ(ここで、R²、nは、前記と同じ意味を示す。)から、一つの置換基を除いた残りの置換基を示す。R'は、低級アルキル基を示す。]

反応に用いられる塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カチウムt-ブトキシドなどの金属アルコキシド、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩、水素化ナトリウムなどの水素化物、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、1, 8-ジアザ-ビシクロ[5. 4. 0]ウンダー7-セン(DBU)、ピリジンなどの有機塩基を例示することができる。また、反応に用いられる溶媒としては、メタノール、エタノールなどのアルコール類、THF、1, 2-ジメトキシエタンなどのエーテル類、DMF、N, N-ジメチルアセタミドなどアミド類、ジメチルスルホオキシド(DMSO)、アセトニトリル、ベンゼン

、トルエン、キシレンなどを例示することができる。

次の酸化反応は、水、酢酸などの有機酸、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素などのハロゲン化炭化水素などの不活性溶媒中、過酸化水素、過酢酸、過安息香酸、*m*-クロロ過安息香酸などの過酸、次亜塩素酸ナトリウム、次亜塩素酸カリウムなどの次亜塩素酸などの酸化剤を使用して行われる。反応は、室温から溶媒の沸点までの温度範囲で円滑に進行する。

本発明化合物の製造の重要な合成中間体であるアルデヒド体 (c) は、以下のように製造できる。

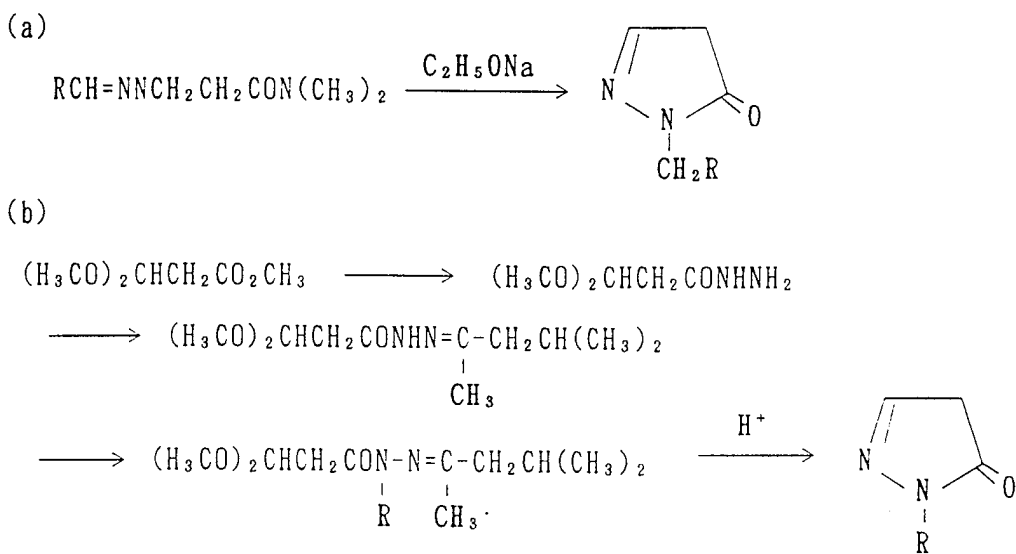


(式中、R¹、R²、Qおよびnは、前記と同じ意味を示し、Wはハロゲン原子を表す。)

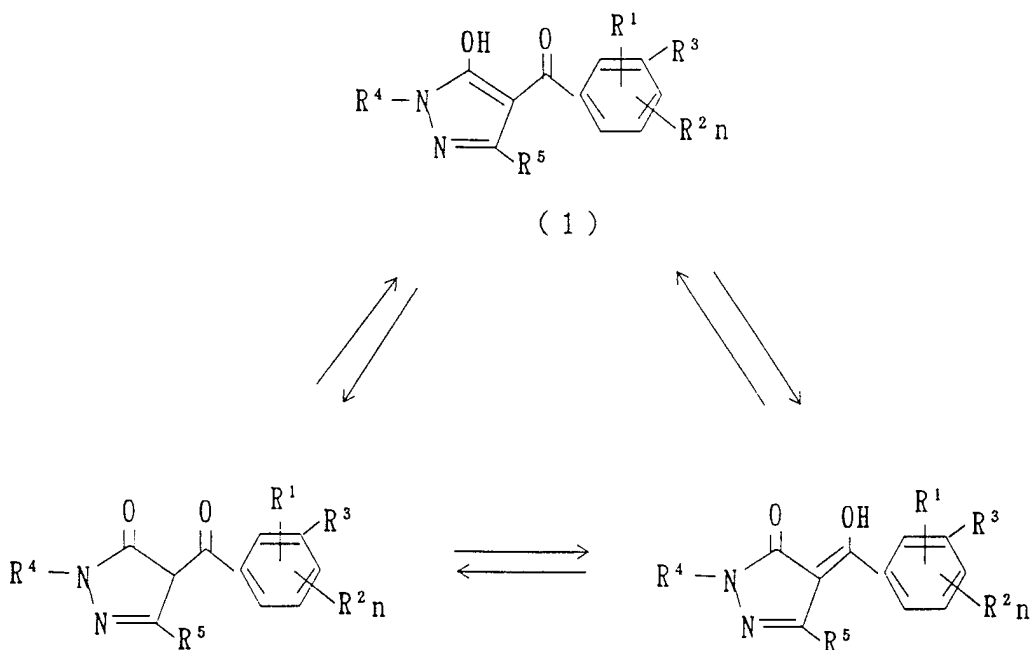
上記反応式に示されるように、トルエン誘導体 (a) から公知の方法、例えば塩素、臭素などの単体のハロゲンあるいはN-ブromoサクシンイミド (NBS)、N-クロロサクシンイミド (NCS) などのハロゲン化剤を、光あるいはベンゾイルペルオキシドなどのラジカル反応開始剤の存在下に反応させることによってベンジルハライド誘導体 (b) を得たのち、例えば、J. Am. Chem. Soc., 71, 1767 (1949) に記載の方法によりアルデヒド体 (c) を製造することができる。すなわち、2-ニトロプロパンなどのニトロアルカン類のアルカリ金属塩とメタノール、エタノールなどのアルコール溶媒中、0℃から溶媒の沸点の間の温度で反応させることによってアルデヒド体 (c) を製造することができる。

一般式 (3) で表される5-ヒドロキシピラゾール類は、例えば、特開昭62-234069号公報または特開平3-44375号公報に記載された以下に例

示する方法に従って製造することができる。



本発明化合物（1）は、多数の互変異性体の形、例えば、下記に示すような形で存在し得る。これらの化合物は、すべて本発明の範囲に含まれる。



化合物（1）が、遊離のヒドロキシル基を含有している場合には、該化合物から、その塩、特に農園芸的に許容され得る塩、エナミンまたはその類似物、アシ

レート、スルホネート、カルバメート、エーテル、チオエーテル、スルホキシドまたはスルホンなどを誘導し得る。適当な農園芸的に許容され得る塩としてナトリウム、カリウム、カルシウムおよびアンモニウムなどの塩が挙げられる。

アンモニウム塩の例としては、式： $N^+ R a R b R c R d$ （式中、 $R a$ 、 $R b$ 、 $R c$ および $R d$ は、それぞれ独立して、水素および、場合により、ヒドロキシ基などにより置換された C_{1-10} アルキル基である）のイオンとの塩が挙げられる。 $R a$ 、 $R b$ 、 $R c$ および $R d$ は、いずれかが、場合により、置換されたアルキル基である場合には、これらは1～4個の炭素原子を含有していることが望ましい。

適当なエナミンまたはその類似物は、OH部分がそれぞれ、式： $-N R e R f$ （式中、 $R e$ および $R f$ は、それぞれ独立して、水素または、例えば炭素数が1～6個の、場合により、置換されたアルキル基またはアリール基、例えばフェニル基である。）、ハロゲン、 $S(O) g R h$ （式中： $R h$ は、例えば炭素数が1～6個の、場合により、置換されたアルキル基またはアリール基、例えばフェニル基であり、 g は0～2を表す。）に転化されている化合物である。

適当なアシレート、エーテルまたはカルバメート誘導体は、OH部分が、それぞれ、式： $-O C O R i$ 、 $-O R j$ または $-O C O N R k R l$ （式中、 $R i$ および $R j$ は、前記の $R h$ と同じ意味を示し、 $R k$ および $R l$ は、前記の $R e$ と同じ意味を示す。）に転化されている化合物である。

これらの誘導体は、慣用の方法で製造し得る。

本発明化合物は、反応終了後、通常の後処理を行うことにより得ることができ、本発明化合物の構造は、IR、NMRおよびMSなどから決定した。

（除草剤）

本発明化合物は畑作条件で、土壌処理、茎葉処理のいずれの方法でも高い除草活性を示し、アキノエロコログサ、エンバク、イチビ、イヌビユなどの各種畑雑草に有効で、トウモロコシ、ムギ、大豆、ワタなどの作物に選択性を示す化合物も含まれている。

また、本発明化合物は、作物、観賞用植物、果樹などの有用植物に対し、生育抑制作用などの植物成長調節作用を示す化合物も含まれている。

また、本発明化合物は、水田雑草のノビエ、タマガヤツリ、オモダカ、ホタルイなどの各種水田雑草に対し、優れた殺草効力を有し、イネに選択性を示す化合物も含まれている。

さらに、本発明化合物は、果樹園、芝生、線路端、空き地などの雑草の防除にも適用することができる。

本発明化合物には植物成長調節作用、殺菌活性、殺虫・殺ダニ活性を有するものも含まれる。

本発明除草剤は、本発明化合物の1種または2種以上を有効成分として含有する。本発明化合物を実際に施用する際には、他成分を加えず純粋な形で使用できるし、また農薬として使用する目的で一般の農薬のとり得る形態、すなわち、水和剤、粒剤、粉剤、乳剤、水溶剤、懸濁剤、フロアブルなどの形態で使用することもできる。添加剤および担体としては固型剤を目的とする場合は、大豆粉、小麦粉などの植物性粉末、珪藻土、燐灰石、石こう、タルク、ベントナイト、パイロフィライト、クレイなどの鉱物性微粉末、安息香酸ソーダ、尿素、芒硝などの有機および無機化合物が使用される。液体の剤型を目的とする場合は、ケロシン、キシレンおよびソルベントナフサなどの石油留分、シクロヘキサン、シクロヘキサノン、DMF、DMSO、アルコール、アセトン、トリクロルエチレン、メチルイソブチルケトン、鉱物油、植物油、水などを溶剤として使用する。これらの製剤において均一かつ安定な形態をとるために、必要ならば界面活性剤を添加することもできる。界面活性剤としては、特に限定はないが、例えば、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンが付加したアルキルエーテル、ポリオキシエチレンが付加した高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したソルビタン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したトリスチリルフェニルエーテル等の非イオン性界面活性剤、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテルの硫酸エステル塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、高級アルコールの硫酸エステル塩、アルキル硫酸塩、アル

キルナフタレンスルホン酸塩、ポリカルボン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩のホルムアルデヒド縮合物、イソブチレン-無水マレイン酸の共重合体などが挙げられる。

本発明除草剤における有効成分濃度は前述した製剤の形により種々の濃度に変化するものであるが、例えば、水和剤に於いては、5～90重量%（以下、単に%と書く。）、好ましくは10～85%：乳剤に於いては、3～70%、好ましくは5～60%：粒剤に於いては、0.01～50%、好ましくは、0.05%～40%の濃度が用いられる。

このようにして得られた水和剤、乳剤は水で所定の濃度に希釈して懸濁液あるいは乳濁液として、粒剤はそのまま雑草の発芽前または発芽後に散布処理もしくは混和処理される。実際に本発明除草剤を適用するに当たっては1ヘクタール当たり有効成分0.1g以上の適当量が施用される。

また、本発明除草剤は公知の殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、植物成長調整剤、肥料などと混合して使用することも出来る。特に、除草剤と混合使用することにより、使用薬量を減少させることが可能である。また、省力化をもたらすのみならず、混合薬剤の相乗作用により一層高い効果も期待できる。その場合、複数の公知除草剤との組合せも可能である。

本発明除草剤と混合使用するにふさわしい薬剤としては、ジフルフェニカン、プロパニルなどのアニリド系除草剤、アラクロール、プレチラクロールなどのクロロアセトアニリド系除草剤、2,4-D, 2,4-DBなどのアリアルオキシアルカン酸系除草剤、ジクロホップ-メチル、フェノキサプロップ-エチルなどのアリアルオキシフェノキシアルカン酸系除草剤、ジカンバ、ピリチオバックなどのアリアルカルボン酸系除草剤、イマザキン、イマゼタピルなどのイミダゾリノン系除草剤、ジウロン、イソプロツロンなどのウレア系除草剤、クロルプロファミン、フェンメジファミンなどのカーバメート系除草剤、チオベンカルブ、EPTCなどのチオカーバメート系除草剤、トリフルラリン、ペンジメタリンなどのジニトロアニリン系除草剤、アシフルオルフェン、ホメサフェンなどのジフェニルエーテル系除草剤、ベンスルフロン-メチル、ニコスルフロンなどのスルホニル

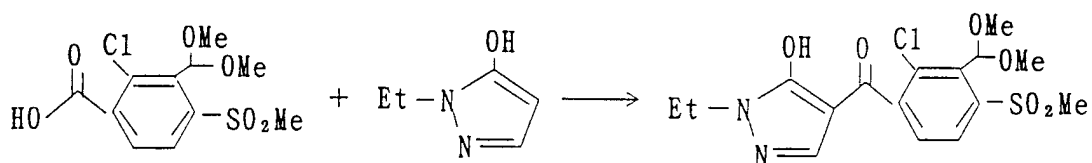
ウレア系除草剤、メトリブジン、メタミトロンなどのトリアジノン系除草剤、アトラジン、シアナジンなどのトリアジン系除草剤、フルメツラムなどのトリアゾピリミジン系除草剤、プロモキシニル、ジクロベニルなどのニトリル系除草剤、グリホサート、グリホシネートなどのリン酸系除草剤、パラコート、ジフェンゾコートなどの4級アンモニウム塩系除草剤、フルミクロラック-ペンチル、フルチアセト-メチルなどの環状イミド系除草剤、その他として、イソキサベン、エトフメセート、オキサジアゾン、キンクロラック、クロマゾン、スルコトリオン、シンメチリン、ジチオピル、ピラゾレート、ピリデート、フルポキサム、ベントゾン、ベンフルセート、更に、セトキシジム、トラルコキシジムなどのシクロヘキサジオン系除草剤などが挙げられる。また、これらの組み合わせたものに植物油及び油濃縮物を添加することも出来る。

発明の実施のための最良の形態：

次に、実施例、参考例を挙げて、本発明を更に具体的に説明する。

実施例 1

1-エチル-5-ヒドロキシ-4-[2-クロロ-4-メタンスルホニル-3-ジメトキシメチルベンゾイル]ピラゾール(化合物番号1-2)の製造



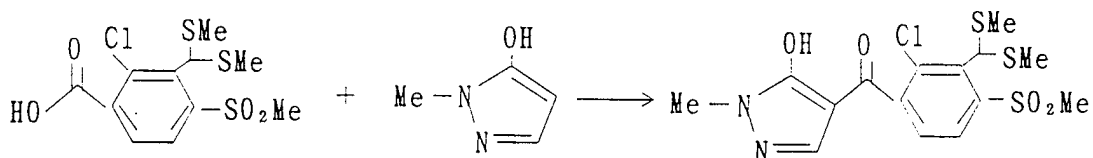
2-クロロ-4-メタンスルホニル-3-ジメトキシメチルベンゾイックアシッド3.0g(9.7ミリモル)を酢酸エチル50mlに溶解し、DCC2.2g(10.7ミリモル)と1-エチル-5-ヒドロキシピラゾール塩酸塩1.4g(9.7ミリモル)を氷冷下に加え、室温で一夜攪拌した。析出した不溶物を濾別後、濾液を減圧下濃縮して得た残留物をクロロホルム30mlに溶解し、アセトンシアンヒドリン0.25g(2.9ミリモル)とトリエチルアミン2.0g(20ミリモル)

を加え、室温で6時間攪拌した。反応混合物を1規定塩酸、次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去した。残った結晶をメタノールで洗浄し、1-エチル-5-ヒドロキシ-4-(2-クロロ-4-メタンスルホニル-3-ジメトキシメチルベンゾイル)ピラゾール1.6gを得た。

m. p. 168-170°C

実施例2

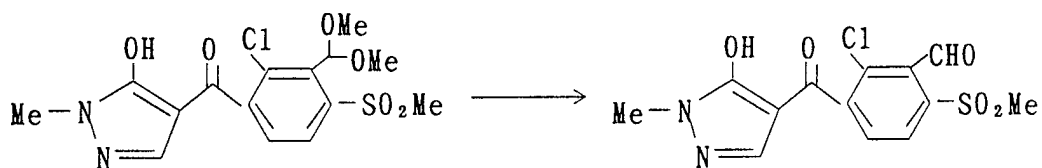
1-メチル-5-ヒドロキシ-4-(2-クロロ-4-メタンスルホニル-3-ジメチルチオメチルベンゾイル)ピラゾール(化合物番号1-6)の製造



2-クロロ-4-メタンスルホニル-3-ジメチルチオベンゾイックアシッド0.84g(2.5ミリモル)を酢酸エチル20mlに溶解し、DCC0.56g(2.8ミリモル)と1-メチル-5-ヒドロキシピラゾール塩酸塩0.33g(2.5ミリモル、さらに、トリエチルアミン0.25g(2.5ミリモル)を氷冷下に加え、室温で一夜攪拌した。析出した不溶物を濾別後、濾液を減圧下濃縮して得た残留物をクロロホルム10mlに溶解し、アセトンシアンヒドリン0.06g(0.7ミリモル)とトリエチルアミン0.5g(5ミリモル)を加え、室温で一夜攪拌した。反応混合物を1規定塩酸、次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去した。残った結晶をメタノールで洗浄し、1-メチル-5-ヒドロキシ-4-(2-クロロ-4-メタンスルホニル-3-ジメチルチオメチルベンゾイル)ピラゾール0.26gを得た。m. p. 215-217°C

実施例3

1-メチル-5-ヒドロキシ-4-(2-クロロ-4-メタンスルホニル-3-ホルミルベンゾイル)ピラゾール(化合物番号2-1)の製造

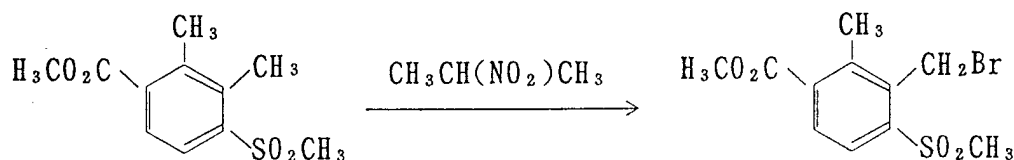


1-メチル-5-ヒドロキシ-4-(2-クロロ-4-メタンスルホニル-3-ジメトキシメチルベンゾイル)ピラゾール1.8 g (4.7ミリモル)をアセトン40 mlに溶解し、塩酸2 mlを室温で加えた。混合物を加熱還流下1時間攪拌し、溶媒を減圧下留去した。析出した結晶をジエチルエーテルで洗浄して、1-メチル-5-ヒドロキシ-4-(2-クロロ-4-メタンスルホニル-3-ホルミルベンゾイル)ピラゾール1.5 gを得た。m. p. 140-142℃

次に、本発明化合物の重要中間体の製造例を参考例として以下に示す。

参考例 1

メチル 3-ブロモメチル-4-メタンスルホニル-2-メチルベンゾエートの製造

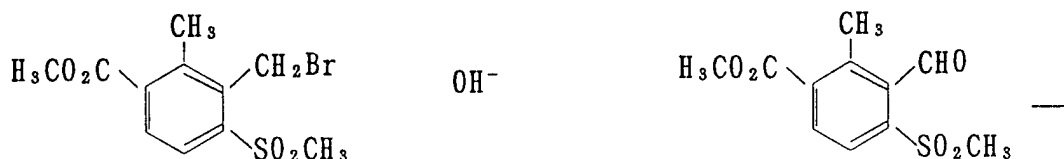


メチル 2,3-ジメチル-4-メタンスルホニルベンゾエート29.69 gを四塩化炭素260 mlに溶解し、NBSを22.93 g、および過酸化ベンゾイル1.0 gを加え、2.5時間加熱還流した。反応液を冷却後、不溶物を濾別し、濾液を減圧濃縮して、粘稠油状物56.58 gを得た。このものをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル)で精製して、白色結晶として表記化合物18.98 gを得た。

参考例 2

メチル 3-ホルミル-4-メタンスルホニル-2-メチルベンゾエートの

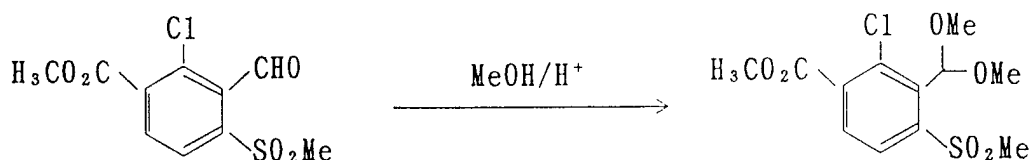
製造



メチル 3-ブロモメチル-4-メタンスルホニル-2-メチルベンゾエート 18.90 g をアセトニトリル 180 ml に溶解させ、室温で、N-メチルモルホリンオキシドの 20.67 g を 10 分間で添加した。そのまま室温で 1 時間攪拌したのち、反応液を氷水にあけ、濃塩酸で酸性とし、ベンゼンで抽出した。有機層を水、次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥の後、溶媒を減圧留去して、白色結晶として表記化合物 11.59 g を得た。粗生成物をエタノールで洗浄して、表記化合物の白色結晶を得た。m. p. 108-110 °C

参考例 3

メチル 2-クロロ-4-メタンスルホニル-3-ジメトキシメチルベンゾエートの製造

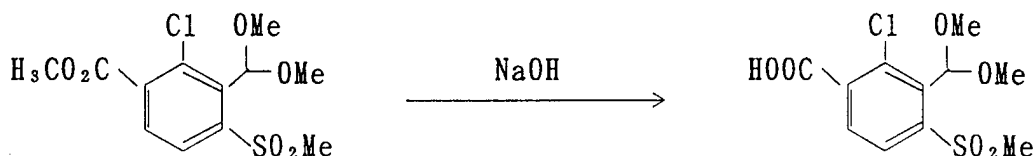


メチル 2-クロロ-4-メタンスルホニル-3-ホルミルベンゾエート 3.0 g (11 ミリモル) をメタノール 50 ml に溶解し、濃硫酸 0.5 g を加え、加熱還流下、8 時間攪拌した。溶媒を減圧下濃縮し、残渣をベンゼンに溶解し、3% 炭酸水素ナトリウム水、次いで、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下濃縮し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物 3.0 g を得た。

¹H-NMR (δ ppm, CDCl₃) : 3.24(3H, s), 3.54(6H, s), 3.98(3H, s), 6.28(1H, s), 7.70(1H, d), 8.19(1H, d)

参考例 4

2-クロロ-4-メタンシルホニル-3-ジメトキシメチルベンゾイックアシッドの製造

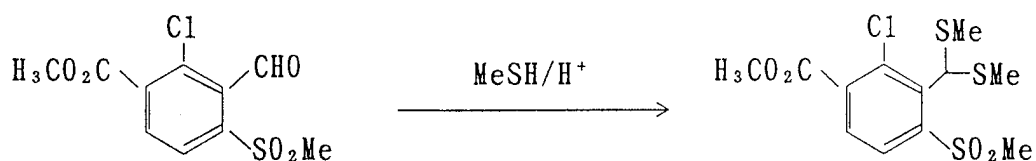


メチル 2-クロロ-4-メタンシルホニル-3-ジメトキシメチルベンゾエート 3.0 g (9.3 ミリモル) をメタノール 30 ml に溶解し、10%水酸化ナトリウム水溶液 20 ml を加え、室温で1時間攪拌した。反応混合物に1規定塩酸を加え、酸性とし、析出した結晶を濾過、水洗後乾燥し、目的物 2.5 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm, CDCl_3) : 2.99(3H, s), 3.56(6H, s), 6.29(1H, s), 7.89(1H, d), 8.24(1H, d)

参考例 5

メチル 2-クロロ-4-メタンシルホニル-3-ジメチルチオメチルベンゾエートの製造



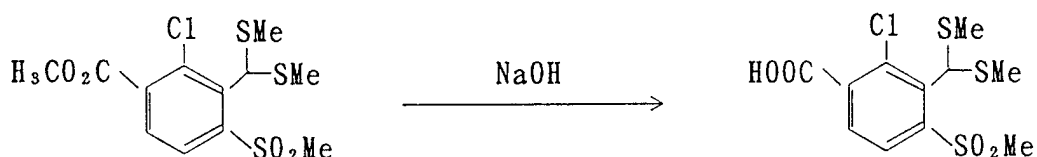
メチル 2-クロロ-4-メタンシルホニル-3-ホルミルベンゾエート 1.5 g (5.4 ミリモル) を塩化メチレン 15 ml に溶解し、メタンチオール 0.65 g (14 ミリモル) を 10°C で吹き込んだ。次いで塩化アルミニウム 0.22 g (1.7 ミリモル) を 10°C で少量ずつ加え、室温にて3時間攪拌した。反応液を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧下濃縮して、目的物 1.8 g

を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm, CDCl_3) : 2.37(6H, s), 3.24(3H, s), 3.98(3H, s), 6.22(1H, s), 7.66(1H, d), 8.10(1H, d)

参考例 6

2-クロロ-4-メタンシルホニル-3-ジメチルチオメチルベンゾイックアシッドの製造

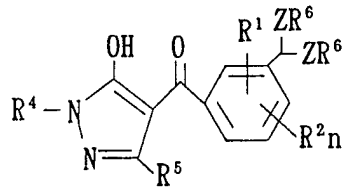


メチル 2-クロロ-4-メタンシルホニル-3-ジメチルチオメチルベンゾエート 1.80 g (5.08 ミリモル) をメタノール 10 ml に溶解し、10%水酸化ナトリウム水溶液 10 ml を加え、室温で 8 時間攪拌した。反応混合物に 1 規定塩酸を加え、酸性とし、析出した結晶を濾過、水洗後、乾燥し、目的物 1.69 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm, CDCl_3) : 2.33(6H, s), 3.22(3H, s), 6.21(1H, s), 7.68(1H, d), 8.04(1H, d)

上記実施例により得られた化合物を含めて、本発明化合物の代表例を第 1 表および第 2 表に示す。

第 1 表



化合物 番 号	R ¹	R ²ⁿ	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 值 [] 熔点°C
1- 1	2-C1	4-SO ₂ Me	Me	H	OMe	[157-159]
1- 2	2-C1	4-SO ₂ Me	Et	H	OMe	[168-170]
1- 3	2-C1	4-SO ₂ Me	Me	Me	OMe	[235-237]
1- 4	2-C1	4-SO ₂ Me	Me	H	OEt	amorphous NMR-1
1- 5	2-C1	4-SO ₂ Me	Et	H	OEt	amorphous NMR-2
1- 6	2-C1	4-SO ₂ Me	Me	H	SMe	[215-217]
1- 7	2-C1	4-SO ₂ Me	Et	H	SMe	[183-185]
1- 8	2-C1	4-SO ₂ Me	Me	Me	SMe	
1- 9	2-C1	4-SO ₂ Me	Me	Et	SMe	
1- 10	2-C1	4-SO ₂ Me	Me	Et	OMe	
1- 11	2-C1	4-SO ₂ Me	Me	CH=CH ₂	OMe	
1- 12	2-C1	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	
1- 13	2-C1	4-SO ₂ Me	Me	C≡CH	OMe	
1- 14	2-C1	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	OMe	
1- 15	2-C1	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	OMe	
1- 16	2-C1	4-SO ₂ Me	Me	cyclohexyl	OMe	
1- 17	2-C1	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	OMe	
1- 18	2-C1	4-SO ₂ Me	Me	CH=CH ₂	SMe	
1- 19	2-C1	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	SMe	

第 1 表 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²ⁿ	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1- 20	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	C≡CH	SMe	
1- 21	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	SMe	
1- 22	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	SMe	
1- 23	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	cyclohexyl	SMe	
1- 24	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	SMe	
1- 25	2-Cl	4-Cl	Me	H	OMe	[161-162]
1- 26	2-Cl	4-Cl	Me	Me	OMe	[176-179]
1- 27	2-Cl	4-Cl	Me	CH=CH ₂	OMe	
1- 28	2-Cl	4-Cl	Me	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	
1- 29	2-Cl	4-Cl	Me	C≡CH	OMe	
1- 30	2-Cl	4-Cl	Me	CH ₂ C≡CH	OMe	
1- 31	2-Cl	4-Cl	Me	cyclopropyl	OMe	
1- 32	2-Cl	4-Cl	Me	cyclohexyl	OMe	
1- 33	2-Cl	4-Cl	Me	CF ₃	OMe	
1- 34	2-Cl	4-Cl	Me	CH ₂ CH=CH ₂	SMe	
1- 35	2-Cl	4-Cl	Me	CH ₂ C≡CH	SMe	
1- 36	2-Cl	4-Cl	Me	cyclopropyl	SMe	
1- 37	2-Cl	4-Cl	Me	CF ₃	SMe	
1- 38	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	H	OMe	[164-167]
1- 39	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	H	OMe	[148-150]
1- 40	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	Me	OMe	
1- 41	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	Et	OMe	
1- 42	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	
1- 43	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	OMe	
1- 44	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	OMe	
1- 45	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	OMe	

第 1 表 (つづき)

化合物 番 号	R ¹	R ² n	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1- 46	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	Me	SMe	
1- 47	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	Et	SMe	
1- 48	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	SMe	
1- 49	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	SMe	
1- 50	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	SMe	
1- 51	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	SMe	
1- 52	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	H	OMe	
1- 53	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	Me	OMe	
1- 54	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	
1- 55	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	OMe	
1- 56	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	OMe	
1- 57	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	OMe	
1- 58	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	H	SMe	
1- 59	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	Me	SMe	
1- 60	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	SMe	
1- 61	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	SMe	
1- 62	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	SMe	
1- 63	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	SMe	
1- 64	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	H	OMe	
1- 65	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	Me	OMe	
1- 66	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	
1- 67	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	OMe	
1- 68	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	OMe	
1- 69	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	OMe	
1- 70	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	H	SMe	
1- 71	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	Me	SMe	

第 1 表 (つづき)

化合物 番 号	R ¹	R ²ⁿ	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1- 72	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	SMe	
1- 73	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	SMe	
1- 74	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	SMe	
1- 75	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	SMe	
1- 76	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	H	OMe	
1- 77	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	Me	OMe	
1- 78	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	
1- 79	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	OMe	
1- 80	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	OMe	
1- 81	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	OMe	
1- 82	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	H	SMe	
1- 83	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	Me	SMe	
1- 84	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	SMe	
1- 85	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	SMe	
1- 86	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	SMe	
1- 87	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	SMe	
1- 88	2-Cl	4-Cl	Et	CH=CH ₂	OMe	
1- 89	2-Cl	4-Cl	Et	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	
1- 90	2-Cl	4-Cl	Et	C≡CH	OMe	
1- 91	2-Cl	4-Cl	Et	CH ₂ C≡CH	OMe	
1- 92	2-Cl	4-Cl	Et	cyclopropyl	OMe	
1- 93	2-Cl	4-Cl	Et	cyclohexyl	OMe	
1- 94	2-Cl	4-Cl	Et	CF ₃	OMe	
1- 95	2-Cl	4-Cl	Et	CH ₂ CH=CH ₂	SMe	
1- 96	2-Cl	4-Cl	Et	CH ₂ C≡CH	SMe	
1- 97	2-Cl	4-Cl	Et	cyclopropyl	SMe	

第 1 表 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²ⁿ	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1- 98	2-Cl	4-Cl	Et	CF ₃	SMe	
1- 99	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	Me	OMe	
1-100	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	Et	OMe	
1-101	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	
1-102	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	OMe	
1-103	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	OMe	
1-104	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	OMe	
1-105	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	Me	SMe	
1-106	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	Et	SMe	
1-107	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	SMe	
1-108	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	SMe	
1-109	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	SMe	
1-110	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	SMe	
1-111	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	H	OMe	
1-112	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	Me	OMe	
1-113	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	
1-114	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	OMe	
1-115	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	OMe	
1-116	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	OMe	
1-117	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	H	SMe	
1-118	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	Me	SMe	
1-119	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	SMe	
1-120	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	SMe	
1-121	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	SMe	
1-122	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	SMe	
1-123	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	H	OMe	

第 1 表 (つづき)

化合物 番 号	R ¹	R ² _n	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1-124	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	Me	OMe	
1-125	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	
1-126	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	OMe	
1-127	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	OMe	
1-128	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	OMe	
1-129	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	H	SMe	
1-130	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	Me	SMe	
1-131	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	SMe	
1-132	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	SMe	
1-133	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	SMe	
1-134	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	SMe	
1-135	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	H	OMe	
1-136	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	Me	OMe	
1-137	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	
1-138	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	OMe	
1-139	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	OMe	
1-140	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	OMe	
1-141	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	H	SMe	
1-142	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	Me	SMe	
1-143	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	SMe	
1-144	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	SMe	
1-145	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	SMe	
1-146	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	SMe	
1-147	2-Cl	4-SMe	Me	H	OMe	
1-148	2-Cl	4-SMe	Et	H	OMe	
1-149	2-Cl	4-SMe	Me	Me	SMe	

第 1 表 (つづき)

化合物 番 号	R ¹	R ²ⁿ	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1-150	2-Cl	4-SMe	Et	Me	SMe	
1-151	2-Cl	4-SOMe	Me	H	OMe	
1-152	2-Cl	4-SOMe	Et	H	OMe	
1-153	2-Cl	4-SOMe	Me	Me	SMe	
1-154	2-Cl	4-SOMe	Et	Me	SMe	
1-155	2-F	4-SO ₂ Me	Me	H	OMe	
1-156	2-F	4-SO ₂ Me	Et	H	OMe	
1-157	2-F	4-SO ₂ Me	Me	Me	SMe	
1-158	2-F	4-SO ₂ Me	Et	Me	SMe	
1-159	2-Br	4-SO ₂ Me	Me	H	OMe	
1-160	2-Br	4-SO ₂ Me	Et	H	OMe	
1-161	2-Br	4-SO ₂ Me	Me	Me	SMe	
1-162	2-Br	4-SO ₂ Me	Et	Me	SMe	
1-163	2-Cl	4-SO ₂ Me	H	H	OMe	
1-164	2-Cl	4-SO ₂ Me	H	H	SMe	
1-165	2-Cl	4-SO ₂ Me	H	Me	OMe	
1-166	2-Cl	5-Cl	Me	H	OMe	
1-167	2-Cl	5-SO ₂ Me	Et	H	OMe	
1-168	2-Cl	5-Me	Me	H	OMe	
1-169	2-Cl	5-OMe	Et	H	OMe	
1-170	2-Cl	5-CF ₃	Me	H	OMe	
1-171	2-Cl	5-OCF ₃	Et	H	OMe	
1-172	2-Cl	5-CN	Me	H	OMe	
1-173	2-Cl	5-NO ₂	Me	H	OMe	
1-174	2-Cl	5-SMe	Me	H	OMe	
1-175	2-Cl	5-SOMe	Et	H	OMe	

第 1 表 (つづき)

化合物 番 号	R ¹	R ²ⁿ	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1-176	2-Cl	5-F	Me	H	OMe	
1-177	2-Cl	5-Br	Et	H	OMe	
1-178	2-Cl	6-SO ₂ Me	Me	H	OMe	
1-179	4-Cl	5-SO ₂ Me	Me	H	OMe	
1-180	4-Cl	6-SO ₂ Me	Me	H	OMe	
1-181	2-SO ₂ Me	4-Cl	H	H	OMe	
1-182	2-SO ₂ Me	4-Cl	Me	H	OMe	
1-183	2-SO ₂ Me	4-Cl	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	
1-184	2-SO ₂ Me	4-Cl	CH ₂ C≡CH	H	OMe	
1-185	2-SO ₂ Me	4-Cl	cyclopropyl	H	OMe	
1-186	2-SO ₂ Me	4-Cl	CF ₃	H	OMe	
1-187	2-SO ₂ Me	4-Me	H	H	OMe	
1-188	2-SO ₂ Me	4-Me	Me	H	OMe	
1-189	2-SO ₂ Me	4-Me	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	
1-190	2-SO ₂ Me	4-Me	CH ₂ C≡CH	H	OMe	
1-191	2-SO ₂ Me	4-Me	cyclopropyl	H	OMe	
1-192	2-SO ₂ Me	4-Me	CF ₃	H	OMe	
1-193	2-SO ₂ Me	4-CF ₃	Me	H	OMe	
1-194	2-SO ₂ Me	4-CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	
1-195	2-SO ₂ Me	4-CF ₃	CH ₂ C≡CH	H	OMe	
1-196	2-SO ₂ Me	4-CF ₃	cyclopropyl	H	OMe	
1-197	2-SO ₂ Me	4-CF ₃	CF ₃	H	OMe	
1-198	2-SO ₂ Me	4-OMe	Me	H	OMe	
1-199	2-SO ₂ Me	4-OMe	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	
1-200	2-SO ₂ Me	4-OMe	CH ₂ C≡CH	H	OMe	
1-201	2-SO ₂ Me	4-OMe	cyclopropyl	H	OMe	

第 1 表 (つづき)

化合物 番 号	R ¹	R ²ⁿ	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1-202	2-SO ₂ Me	4-OMe	CF ₃	H	OMe	
1-203	2-SO ₂ Me	4-OCF ₃	Me	H	OMe	
1-204	2-SO ₂ Me	4-OCF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	
1-205	2-SO ₂ Me	4-OCF ₃	CH ₂ C≡CH	H	OMe	
1-206	2-SO ₂ Me	4-OCF ₃	cyclopropyl	H	OMe	
1-207	2-SO ₂ Me	4-OCF ₃	CF ₃	H	OMe	
1-208	2-SMe	4-Cl	Et	H	OMe	
1-209	2-SOMe	4-Cl	Et	H	OMe	
1-210	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	H	OEt	
1-211	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	H	SEt	
1-212	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	H	OPr ⁱ	
1-213	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	H	SPr ⁱ	
1-214	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	H	OBu	
1-215	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	H	SBu	
1-216	2-Cl	4-SO ₂ Me	Pr ⁱ	H	OMe	
1-217	2-Cl	4-SO ₂ Me	Bu	H	OMe	
1-218	2-Cl	4-SO ₂ Me	Pr ⁱ	H	SMe	
1-219	2-Cl	4-SO ₂ Me	Bu	H	SMe	
1-220	2-NO ₂	4-Cl	Me	H	OMe	
1-221	2-NO ₂	4-Cl	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	
1-222	2-NO ₂	4-Cl	CH ₂ C≡CH	H	OMe	
1-223	2-NO ₂	4-Cl	cyclopropyl	H	OMe	
1-224	2-NO ₂	4-Cl	CF ₃	H	OMe	
1-225	2-NO ₂	4-Cl	Me	H	SMe	
1-226	2-NO ₂	4-Cl	CH ₂ CH=CH ₂	H	SMe	
1-227	2-NO ₂	4-Cl	CH ₂ C≡CH	H	SMe	

第 1 表 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²ⁿ	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1-228	2-NO ₂	4-Cl	cyclopropyl	H	SMe	
1-229	2-NO ₂	4-Cl	CF ₃	H	SMe	
1-230	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	Me	H	OMe	
1-231	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	
1-232	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	CH ₂ C≡CH	H	OMe	
1-233	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	cyclopropyl	H	OMe	
1-234	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	CF ₃	H	OMe	
1-235	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	Me	H	SMe	
1-236	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	CH ₂ CH=CH ₂	H	SMe	
1-237	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	CH ₂ C≡CH	H	SMe	
1-238	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	cyclopropyl	H	SMe	
1-239	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	CF ₃	H	SMe	
1-240	2-CN	4-Cl	Me	H	OMe	
1-241	2-CN	4-Cl	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	
1-242	2-CN	4-Cl	CH ₂ C≡CH	H	OMe	
1-243	2-CN	4-Cl	cyclopropyl	H	OMe	
1-244	2-CN	4-Cl	CF ₃	H	OMe	
1-245	2-CN	4-SO ₂ Me	Me	H	OMe	
1-246	2-CN	4-SO ₂ Me	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	
1-247	2-CN	4-SO ₂ Me	CH ₂ C≡CH	H	OMe	
1-248	2-CN	4-SO ₂ Me	cyclopropyl	H	OMe	
1-249	2-CN	4-SO ₂ Me	CF ₃	H	OMe	
1-250	2-CN	4-CF ₃	Me	H	OMe	
1-251	2-CN	4-CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	
1-252	2-CN	4-CF ₃	CH ₂ C≡CH	H	OMe	
1-253	2-CN	4-CF ₃	cyclopropyl	H	OMe	

第 1 表 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²ⁿ	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1-254	2-CN	4-CF ₃	CF ₃	H	OMe	
1-255	2-CN	4-Cl	Me	H	SMe	
1-256	2-CN	4-Cl	CH ₂ CH=CH ₂	H	SMe	
1-257	2-CN	4-Cl	CH ₂ C≡CH	H	SMe	
1-258	2-CN	4-Cl	cyclopropyl	H	SMe	
1-259	2-CN	4-Cl	CF ₃	H	SMe	
1-260	2-CN	4-SO ₂ Me	Me	H	SMe	
1-261	2-CN	4-SO ₂ Me	CH ₂ CH=CH ₂	H	SMe	
1-262	2-CN	4-SO ₂ Me	CH ₂ C≡CH	H	SMe	
1-263	2-CN	4-SO ₂ Me	cyclopropyl	H	SMe	
1-264	2-CN	4-SO ₂ Me	CF ₃	H	SMe	
1-265	2-CN	4-CF ₃	Me	H	SMe	
1-266	2-CN	4-CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	SMe	
1-267	2-CN	4-CF ₃	CH ₂ C≡CH	H	SMe	
1-268	2-CN	4-CF ₃	cyclopropyl	H	SMe	
1-269	2-CN	4-CF ₃	CF ₃	H	SMe	
1-270	2-CF ₃	4-CN	Me	H	OMe	
1-271	2-CF ₃	4-CN	CH ₂ CH=CH ₂	H	OMe	
1-272	2-CF ₃	4-CN	CH ₂ C≡CH	H	OMe	
1-273	2-CF ₃	4-CN	cyclopropyl	H	OMe	
1-274	2-CF ₃	4-CN	CF ₃	H	OMe	
1-275	2-CF ₃	4-CN	Me	H	SMe	
1-276	2-CF ₃	4-CN	CH ₂ CH=CH ₂	H	SMe	
1-277	2-CF ₃	4-CN	CH ₂ C≡CH	H	SMe	
1-278	2-CF ₃	4-CN	cyclopropyl	H	SMe	
1-279	2-CF ₃	4-CN	CF ₃	H	SMe	

第 1 表 (つづき)

化合物 番 号	R ¹	R ²ⁿ	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1-280	2-CF ₃	4-CF ₃	Me	H	OMe	
1-281	2-CF ₃	4-CF ₃	Et	H	OMe	
1-282	2-CF ₃	4-CF ₃	Me	H	SMe	
1-283	2-CF ₃	4-CF ₃	Et	H	SMe	
1-284	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	OMe	
1-285	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	OMe	
1-286	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	OMe	
1-287	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	OMe	
1-288	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	OMe	amorphous NMR-5
1-289	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	OMe	
1-290	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	OMe	amorphous NMR-6
1-291	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	OMe	
1-292	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	SMe	
1-293	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	SMe	
1-294	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	SMe	
1-295	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	SMe	
1-296	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	SMe	
1-297	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	SMe	
1-298	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	SMe	
1-299	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	SMe	
1-300	2-CF ₃	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	OMe	
1-301	2-CF ₃	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	OMe	
1-302	2-CF ₃	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	OMe	
1-303	2-CF ₃	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	OMe	
1-304	2-OMe	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	OMe	
1-305	2-OMe	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	OMe	

第 1 表 (つづき)

化合物 番 号	R ¹	R ²ⁿ	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1-306	2-OMe	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	OMe	
1-307	2-OMe	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	OMe	
1-308	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	OMe	
1-309	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	OMe	
1-310	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	OMe	
1-311	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	OMe	
1-312	2-CN	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	OMe	
1-313	2-CN	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	OMe	
1-314	2-CN	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	OMe	
1-315	2-CN	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	OMe	
1-316	2-NO ₂	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	OMe	
1-317	2-NO ₂	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	OMe	
1-318	2-NO ₂	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	OMe	
1-319	2-NO ₂	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	OMe	
1-320	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	Me	OMe	
1-321	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	Me	SMe	
1-322	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-CF ₃	Me	H	OMe	
1-323	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-CF ₃	Et	H	OMe	
1-324	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-OMe	Me	H	OMe	
1-325	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-OMe	Et	H	OMe	
1-326	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-OCF ₃	Me	H	OMe	
1-327	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-OCF ₃	Et	H	OMe	
1-328	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-CN	Me	H	OMe	
1-329	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-CN	Et	H	OMe	
1-330	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-NO ₂	Me	H	OMe	
1-331	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-NO ₂	Et	H	OMe	

第 1 表 (つづき)

化合物 番 号	R ¹	R ² _n	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1-332	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	amorphous NMR-3
1-333	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	amorphous NMR-4
1-334	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-335	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	Et	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-336	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CH=CH ₂	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-337	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-338	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	C≡CH	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-339	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-340	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-341	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	cyclohexyl	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-342	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-343	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	CH=CH ₂	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-344	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-345	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	C≡CH	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-346	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-347	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-348	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	cyclohexyl	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-349	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-350	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	H	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-351	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	H	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-352	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	Me	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-353	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	Et	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-354	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CH=CH ₂	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-355	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-356	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	C≡CH	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-357	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	SCH ₂ CH ₂ Cl	

第 1 表 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ² _n	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1-358	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-359	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	cyclohexyl	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-360	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-361	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	CH=CH ₂	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-362	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-363	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	C≡CH	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-364	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-365	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-366	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	cyclohexyl	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-367	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-368	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	H	OCF ₃	
1-369	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	H	OCF ₃	
1-370	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	Me	OCF ₃	
1-371	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	Et	OCF ₃	
1-372	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	OCF ₃	
1-373	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	OCF ₃	
1-374	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	OCF ₃	
1-375	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	OCF ₃	
1-376	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	H	SCF ₃	
1-377	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	H	SCF ₃	
1-378	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	Me	SCF ₃	
1-379	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	Et	SCF ₃	
1-380	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	SCF ₃	
1-381	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	SCF ₃	
1-382	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	SCF ₃	
1-383	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	SCF ₃	

第 1 表 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²ⁿ	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1-384	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	Me	OCF ₃	
1-385	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	OCF ₃	
1-386	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	OCF ₃	
1-387	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	OCF ₃	
1-388	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	OCF ₃	
1-389	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	Me	SCF ₃	
1-390	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	SCF ₃	
1-391	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	SCF ₃	
1-392	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	SCF ₃	
1-393	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	SCF ₃	
1-394	2-Cl	4-Cl	Me	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-395	2-Cl	4-Cl	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-396	2-Cl	4-Cl	Me	CH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-397	2-Cl	4-Cl	Me	CH ₂ C≡CH	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-398	2-Cl	4-Cl	Me	cyclopropyl	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-399	2-Cl	4-Cl	Me	CF ₃	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-400	2-Cl	4-Cl	Me	H	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-401	2-Cl	4-Cl	Me	Me	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-402	2-Cl	4-Cl	Me	CH ₂ CH=CH ₂	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-403	2-Cl	4-Cl	Me	CH ₂ C≡CH	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-404	2-Cl	4-Cl	Me	cyclopropyl	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-405	2-Cl	4-Cl	Me	CF ₃	SCH ₂ CH ₂ Cl	
1-406	2-Cl	4-Cl	Et	H	OCF ₃	
1-407	2-Cl	4-Cl	Et	Me	OCF ₃	
1-408	2-Cl	4-Cl	Et	CH ₂ CH=CH ₂	OCF ₃	
1-409	2-Cl	4-Cl	Et	CH ₂ C≡CH	OCF ₃	

第 1 表 (つづき)

化合物 番 号	R ¹	R ² _n	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1-410	2-Cl	4-Cl	Et	cyclopropyl	OCF ₃	
1-411	2-Cl	4-Cl	Et	CF ₃	OCF ₃	
1-412	2-Cl	4-Cl	Et	H	SCF ₃	
1-413	2-Cl	4-Cl	Et	Me	SCF ₃	
1-414	2-Cl	4-Cl	Et	CH ₂ CH=CH ₂	SCF ₃	
1-415	2-Cl	4-Cl	Et	CH ₂ C≡CH	SCF ₃	
1-416	2-Cl	4-Cl	Et	cyclopropyl	SCF ₃	
1-417	2-Cl	4-Cl	Et	CF ₃	SCF ₃	
1-418	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-419	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-420	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-421	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-422	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-423	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-424	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-425	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-426	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-427	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-428	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-429	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-430	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	H	OCF ₃	
1-431	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	Me	OCF ₃	
1-432	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	OCF ₃	
1-433	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	OCF ₃	
1-434	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	OCF ₃	
1-435	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	OCF ₃	

第 1 表 (つづき)

化合物 番 号	R ¹	R ²ⁿ	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1-436	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	H	OCF ₃	
1-437	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	Me	OCF ₃	
1-438	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	OCF ₃	
1-439	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	OCF ₃	
1-440	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	OCF ₃	
1-441	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	OCF ₃	
1-442	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-443	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-444	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-445	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-446	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	H	OCF ₃	
1-447	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	Me	OCF ₃	
1-448	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	H	OCF ₃	
1-449	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	Me	OCF ₃	
1-450	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-451	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-452	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-453	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-454	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	H	OCF ₃	
1-455	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	Me	OCF ₃	
1-456	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	H	OCF ₃	
1-457	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	Me	OCF ₃	
1-458	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-459	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-460	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-461	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ Cl	

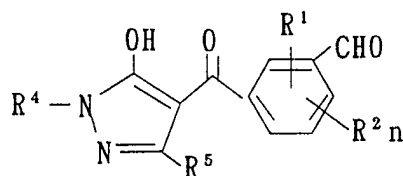
第 1 表 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²ⁿ	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1-462	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	H	OCF ₃	
1-463	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	Me	OCF ₃	
1-464	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	H	OCF ₃	
1-465	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	Me	OCF ₃	
1-466	2-CN	4-SO ₂ Me	Me	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-467	2-CN	4-SO ₂ Me	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-468	2-CN	4-SO ₂ Me	Et	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-469	2-CN	4-SO ₂ Me	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-470	2-CN	4-SO ₂ Me	Me	H	OCF ₃	
1-471	2-CN	4-SO ₂ Me	Me	Me	OCF ₃	
1-472	2-CN	4-SO ₂ Me	Et	H	OCF ₃	
1-473	2-CN	4-SO ₂ Me	Et	Me	OCF ₃	
1-474	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	Me	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-475	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-476	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	Et	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-477	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-478	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	Me	H	OCF ₃	
1-479	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	Me	Me	OCF ₃	
1-480	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	Et	H	OCF ₃	
1-481	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	Et	Me	OCF ₃	
1-482	2-Cl	5-Cl	Me	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-483	2-Cl	5-SO ₂ Me	Et	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-484	2-Cl	5-Me	Me	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-485	2-Cl	5-CF ₃	Et	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-486	2-Cl	5-OMe	Me	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-487	2-Cl	5-OCF ₃	Et	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	

第 1 表 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ²ⁿ	R ⁴	R ⁵	ZR ⁶	物 性 値 [] 融点°C
1-488	2-Cl	5-CN	Me	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-489	2-Cl	5-NO ₂	Et	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-490	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-491	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-492	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-493	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-494	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-495	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-496	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-497	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1-498	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	OCF ₃	
1-499	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	OCF ₃	
1-500	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	OCF ₃	
1-500	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	OCF ₃	
1-501	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	OCF ₃	
1-502	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	OCF ₃	
1-503	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	OCF ₃	
1-504	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	OCF ₃	

第 2 表



化合物 番 号	R ¹	R ²ⁿ	R ⁴	R ⁵	物 性 值 [] 熔点 °C
2- 1	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	H	[140- 142]
2- 2	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	H	[202- 204]
2- 3	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	Me	[174- 178]
2- 4	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	H	
2- 5	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	H	
2- 6	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CH=CH ₂	
2- 7	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	
2- 8	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	C≡CH	
2- 9	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	
2- 10	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	
2- 11	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	cyclohexyl	
2- 12	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	
2- 13	2-Cl	4-Cl	Me	H	
2- 14	2-Cl	4-Cl	Me	Me	
2- 15	2-Cl	4-Cl	Me	CH=CH ₂	
2- 16	2-Cl	4-Cl	Me	CH ₂ CH=CH ₂	
2- 17	2-Cl	4-Cl	Me	C≡CH	
2- 18	2-Cl	4-Cl	Me	CH ₂ C≡CH	
2- 19	2-Cl	4-Cl	Me	cyclopropyl	
2- 20	2-Cl	4-Cl	Me	cyclohexyl	

第 2 表 (つづき)

化合物 番 号	R ¹	R ² n	R ⁴	R ⁵	物 性 值 [] 融点 °C
2- 21	2-Cl	4-Cl	Me	CF ₃	[185- 187]
2- 22	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	H	
2- 23	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	CH=CH ₂	
2- 24	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	
2- 25	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	C≡CH	
2- 26	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	
2- 27	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	
2- 28	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	cyclohexyl	
2- 29	2-Me	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	
2- 30	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	H	
2- 31	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	Me	
2- 32	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	
2- 33	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	
2- 34	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	
2- 35	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	
2- 36	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	H	
2- 37	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	Me	
2- 38	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	
2- 39	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	
2- 40	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	
2- 41	2-OMe	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	
2- 42	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	H	
2- 43	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	Me	
2- 44	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	
2- 45	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	CH ₂ C≡CH	
2- 46	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	cyclopropyl	

第 2 表 (つづき)

化合物 番 号	R ¹	R ²ⁿ	R ⁴	R ⁵	物 性 値 [] 融点℃
2- 47	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Me	CF ₃	[211- 213]
2- 48	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	CH=CH ₂	
2- 49	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	
2- 50	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	C≡CH	
2- 51	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	
2- 52	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	
2- 53	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	cyclohexyl	
2- 54	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	
2- 55	2-Cl	4-Cl	Et	H	
2- 56	2-Cl	4-Cl	Et	Me	
2- 57	2-Cl	4-Cl	Et	CH=CH ₂	
2- 58	2-Cl	4-Cl	Et	CH ₂ CH=CH ₂	
2- 59	2-Cl	4-Cl	Et	C≡CH	
2- 60	2-Cl	4-Cl	Et	CH ₂ C≡CH	
2- 61	2-Cl	4-Cl	Et	cyclopropyl	
2- 62	2-Cl	4-Cl	Et	cyclohexyl	
2- 63	2-Cl	4-Cl	Et	CF ₃	
2- 64	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	H	
2- 65	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	CH=CH ₂	
2- 66	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	
2- 67	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	C≡CH	
2- 68	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	
2- 69	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	
2- 70	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	cyclohexyl	
2- 71	2-Me	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	
2- 72	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	H	

第 2 表 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ² n	R ⁴	R ⁵	物 性 値 [] 融点°C
2- 73	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	Me	
2- 74	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	
2- 75	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	
2- 76	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	
2- 77	2-CF ₃	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	
2- 78	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	H	
2- 79	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	Me	
2- 80	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	
2- 81	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	
2- 82	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	
2- 83	2-OMe	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	
2- 84	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	H	
2- 85	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	Me	
2- 86	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ CH=CH ₂	
2- 87	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	CH ₂ C≡CH	
2- 88	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	cyclopropyl	
2- 89	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me	Et	CF ₃	
2- 90	2-Cl	4-SMe	Me	H	
2- 91	2-Cl	4-SMe	Et	H	
2- 92	2-Cl	4-SMe	Me	Me	
2- 93	2-Cl	4-SMe	Et	Me	
2- 94	2-Cl	4-SOMe	Me	H	
2- 95	2-Cl	4-SOMe	Et	H	
2- 96	2-Cl	4-SOMe	Me	Me	
2- 97	2-Cl	4-SOMe	Et	Me	
2- 98	2-F	4-SO ₂ Me	Me	H	

第 2 表 (つづき)

化合物 番 号	R ¹	R ² n	R ⁴	R ⁵	物 性 値 [] 融点 °C
2- 99	2-F	4-SO ₂ Me	Et	H	
2-100	2-F	4-SO ₂ Me	Me	Me	
2-101	2-F	4-SO ₂ Me	Et	Me	
2-102	2-Br	4-SO ₂ Me	Me	H	
2-103	2-Br	4-SO ₂ Me	Et	H	
2-104	2-Br	4-SO ₂ Me	Me	Me	
2-105	2-Br	4-SO ₂ Me	Et	Me	
2-106	2-Cl	4-SO ₂ Et	Me	H	
2-107	2-Cl	4-SO ₂ Et	Et	H	
2-108	2-Cl	4-SO ₂ Et	Me	Me	
2-109	2-Cl	4-SO ₂ Et	Et	Me	
2-110	2-Cl	5-Cl	Me	H	
2-111	2-Cl	5-Me	Et	H	
2-112	2-Cl	5-SO ₂ Me	Me	H	
2-113	2-Cl	5-CF ₃	Et	H	
2-114	2-Cl	5-OMe	Me	H	
2-115	2-Cl	5-OCF ₃	Me	Me	
2-116	2-Cl	5-CN	Me	H	
2-117	2-Cl	5-NO ₂	Et	H	
2-118	2-Cl	5-F	Me	H	
2-119	2-Cl	5-Br	Et	H	
2-120	2-Cl	6-SO ₂ Me	Me	H	
2-121	4-Cl	5-SO ₂ Me	Me	H	
2-122	4-Cl	6-SO ₂ Me	Me	H	
2-123	2-SO ₂ Me	4-Cl	H	H	
2-124	2-SO ₂ Me	4-Cl	Me	H	

第 2 表 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ² _n	R ⁴	R ⁵	物 性 値 [] 融点 °C
2-125	2-SO ₂ Me	4-Cl	Et	H	
2-126	2-SO ₂ Me	4-Cl	CH ₂ CH=CH ₂	H	
2-127	2-SO ₂ Me	4-Cl	CH ₂ C≡CH	H	
2-128	2-SO ₂ Me	4-Cl	cyclopropyl	H	
2-129	2-SO ₂ Me	4-Cl	CF ₃	H	
2-130	2-SO ₂ Me	4-Me	Me	H	
2-131	2-SO ₂ Me	4-Me	Et	H	
2-132	2-SO ₂ Me	4-Me	CH ₂ CH=CH ₂	H	
2-133	2-SO ₂ Me	4-Me	CH ₂ C≡CH	H	
2-134	2-SO ₂ Me	4-Me	cyclopropyl	H	
2-135	2-SO ₂ Me	4-Me	CF ₃	H	
2-136	2-SO ₂ Me	4-CF ₃	Me	H	
2-137	2-SO ₂ Me	4-CF ₃	Et	H	
2-138	2-SO ₂ Me	4-CF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	
2-139	2-SO ₂ Me	4-CF ₃	CH ₂ C≡CH	H	
2-140	2-SO ₂ Me	4-CF ₃	cyclopropyl	H	
2-141	2-SO ₂ Me	4-CF ₃	CF ₃	H	
2-142	2-SO ₂ Me	4-OMe	Me	H	
2-143	2-SO ₂ Me	4-OMe	Et	H	
2-144	2-SO ₂ Me	4-OMe	CH ₂ CH=CH ₂	H	
2-145	2-SO ₂ Me	4-OMe	CH ₂ C≡CH	H	
2-146	2-SO ₂ Me	4-OMe	cyclopropyl	H	
2-147	2-SO ₂ Me	4-OMe	CF ₃	H	
2-148	2-SO ₂ Me	4-OCF ₃	Me	H	
2-149	2-SO ₂ Me	4-OCF ₃	Et	H	
2-150	2-SO ₂ Me	4-OCF ₃	CH ₂ CH=CH ₂	H	

第 2 表 (つづき)

化合物 番 号	R ¹	R ²ⁿ	R ⁴	R ⁵	物 性 値 [] 融点 °C
2-151	2-SO ₂ Me	4-OCF ₃	CH ₂ C≡CH	H	
2-152	2-SO ₂ Me	4-OCF ₃	cyclopropyl	H	
2-153	2-SO ₂ Me	4-OCF ₃	CF ₃	H	
2-154	2-SMe	4-Cl	Me	H	
2-155	2-SMe	4-Cl	Me	Me	
2-156	2-SMe	4-Cl	Et	H	
2-157	2-SOMe	4-Cl	Me	H	
2-158	2-SOMe	4-Cl	Et	H	
2-159	2-NO ₂	4-Cl	Me	H	
2-160	2-NO ₂	4-Cl	Et	H	
2-161	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	Me	H	
2-162	2-NO ₂	4-SO ₂ Me	Et	H	
2-163	2-Cl	4-NO ₂	Me	H	
2-164	2-Cl	4-NO ₂	Et	H	
2-165	2-Cl	4-NO ₂	Me	Me	
2-166	2-CN	4-Cl	Me	H	
2-167	2-CN	4-Cl	Et	H	
2-168	2-CN	4-CN	Me	H	
2-169	2-CN	4-CN	Et	H	
2-170	2-Cl	4-CN	Me	Me	
2-171	2-Cl	4-SO ₂ Me	Me	H	
2-172	2-Cl	4-SO ₂ Me	Et	H	
2-173	2-CN	4-SO ₂ Me	CH ₂ CH=CH ₂	H	
2-174	2-CN	4-SO ₂ Me	CH ₂ C≡CH	H	
2-175	2-CN	4-SO ₂ Me	cyclopropyl	H	
2-176	2-CN	4-SO ₂ Me	CF ₃	H	

第 2 表 (つづき)

化合物 番号	R ¹	R ² _n	R ⁴	R ⁵	物 性 値 [] 融点 °C
2-177	2-CN	4-CF ₃	Me	H	
2-178	2-CN	4-CF ₃	Et	H	
2-179	2-CN	4-CF ₃	Me	H	
2-180	2-CN	4-CF ₃	Pr ⁱ	H	
2-181	2-CF ₃	4-CN	Me	H	
2-182	2-CF ₃	4-CN	Et	H	
2-183	2-CF ₃	4-CN	Me	Me	
2-184	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	
2-185	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	
2-186	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	
2-187	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	
2-188	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	
2-189	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	
2-190	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	
2-191	2-Me	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	
2-192	2-CF ₃	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	
2-193	2-CF ₃	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	
2-194	2-CF ₃	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	
2-195	2-CF ₃	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	
2-196	2-OMe	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	
2-197	2-OMe	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	
2-198	2-OMe	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	
2-199	2-OMe	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	
2-200	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	
2-201	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	
2-202	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	

第 2 表 (つづき)

化合物 番 号	R ¹	R ² _n	R ⁴	R ⁵	物 性 値 [] 融点℃
2-203	2-OCF ₃	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	
2-204	2-CN	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	
2-205	2-CN	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	
2-206	2-CN	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	
2-207	2-CN	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	
2-208	2-NO ₂	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	H	
2-209	2-NO ₂	4-SO ₂ Me-5-Me	Me	H	
2-210	2-NO ₂	4-SO ₂ Me-5-Cl	Et	H	
2-211	2-NO ₂	4-SO ₂ Me-5-Me	Et	H	
2-212	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	Me	
2-213	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-Cl	Me	Me	
2-214	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-CF ₃	Me	H	
2-215	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-CF ₃	Et	H	
2-216	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-OMe	Me	H	
2-217	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-OMe	Et	H	
2-218	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-OCF ₃	Me	H	
2-219	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-OCF ₃	Et	H	
2-220	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-CN	Me	H	
2-221	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-CN	Et	H	
2-222	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-NO ₂	Me	H	
2-223	2-Cl	4-SO ₂ Me-5-NO ₂	Et	H	

本発明化合物の $^1\text{H-NMR}$ (CDC1₃, δ ppm from TMS) データを、次に示す。

NMR-1 (化合物番号 1-4) : 1.26(6H, t), 3.28(3H, s), 3.60(2H, m), 3.70(3H, s), 3.86(2H, m), 6.45(1H, s), 7.29(1H, s), 7.50(1H, d), 8.21(1H, d)

NMR-2 (化合物番号 1-5) : 1.27(6H, t), 1.45(3H, t), 3.31(3H, s), 3.63(2H, m), 3.88(2H, m), 4.08(2H, q), 6.47(1H, s), 7.30(1H, s), 7.51(1H, d), 8.23(1H, d)

NMR-3 (化合物番号 1-332) : 1.46(4H, t), 3.34(3H, s), 3.71(4H, t), 3.89(2H, q), 4.12(4H, t), 6.64(1H, s), 7.32(1H, s), 7.57(1H, d), 8.23(1H, d)

NMR-4 (化合物番号 1-333) : 3.32(3H, s), 3.70(3H, s), 3.72(4H, t), 3.88(2H, q), 4.11(4H, t), 6.63(1H, s), 7.31(1H, s), 7.56(1H, d), 8.22(1H, d)

NMR-5 (化合物番号 1-288) : 1.46(3H, t), 2.45(3H, s), 2.63(3H, s), 3.12(3H, s), 3.53(6H, s), 4.07(2H, q), 6.43(1H, s), 7.29(1H, s), 7.51(1H, s)

NMR-6 (化合物番号 1-290) : 2.44(3H, s), 2.62(3H, s), 3.52(6H, s), 3.73(3H, s), 6.46(1H, s), 7.28(1H, s), 7.48(1H, s)

(除草剤)

次に、本発明除草剤に関する製剤例を若干示すが、有効成分化合物、添加物および添加割合は、本実施例にのみ限定されることなく、広い範囲で変更可能である。製剤実施例中の部は重量部を示す。

実施例 4 水和剤

本発明化合物	20部
ホワイトカーボン	20部
ケイソウ土	52部
アルキル硫酸ソーダ	8部

以上を均一に混合、微細に粉砕して、有効成分20%の水和剤を得た。

実施例 5 乳剤

本発明化合物	20部
キシレン	55部
ジメチルホルムアミド	15部

ポリオキシエチレンフェニルエーテル 10部

以上を混合、溶解して有効成分20%の乳剤を得た。

実施例6 粒剤

本発明化合物 5部

タルク 40部

クレー 38部

ベントナイト 10部

アルキル硫酸ソーダ 7部

以上を均一に混合して微細に粉碎後、直径0.5～1.0mmの粒状に造粒して有効成分5%の粒剤を得た。

次に本発明除草剤の効果に関する試験例を示す。

除草効果は下記の調査基準に従って調査し、殺草指数で表した。

調査基準

殺草率	殺草指数
0%	0
20～29%	2
40～49%	4
60～69%	6
80～89%	8
100%	10

また、1、3、5、7、9の数値は、各々0と2、2と4、4と6、6と8、8と10の中間の値を示す。

(無処理区の地上部生草重 - 処理区の地上部生草重)

$$\text{殺草率 (\%)} = \frac{\text{無処理区の地上部生草重} - \text{処理区の地上部生草重}}{\text{無処理区の地上部生草重}} \times 100$$

試験例1 茎葉散布処理

200cm²のポットに土壌を充填し、表層に、イチビ、イヌビユ、オナモミ、アキノエノコログサおよびトウモロコシの各種子を播き、軽く覆土後、温室内

で生育させた。各植物が5～25cmの草丈に生育した時点で、実施例5に示した乳剤の水希釈液を、有効成分が所定の薬量になるように、1000リットル/ha散布量相当量で、小型噴霧器にて茎葉部に散布した。3週間後に作物の薬害および雑草の除草効果を、前記調査基準に従って調査し、その結果を第3表に示した。

第 3 表

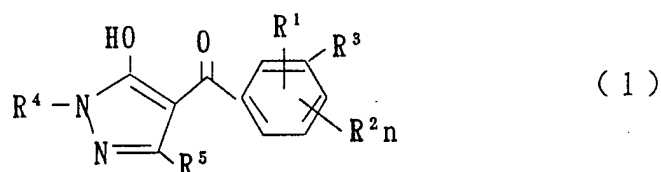
化合物 番 号	薬量 g/ha	イチビ	イヌビユ	オナモミ	アキノエノ コログサ	トウモロ コシ
1- 1	250	10	10	10	10	9
1- 2	250	10	10	10	10	2
1- 3	250	8	10	10	10	6
1- 4	250	10	10	10	10	8
1- 5	250	10	10	10	10	6
1- 25	250	10	10	10	4	6
1- 26	250	10	8	10	10	7
1- 38	250	10	10	10	10	6
1- 39	250	10	10	10	10	0
1-332	250	8	10	10	10	6
1-333	250	10	10	10	10	4
2- 1	250	8	10	8	10	0
2- 2	250	9	10	10	10	0
2- 3	250	8	7	9	10	0

産業上の利用可能性：

本発明化合物は、工業的に有利に合成でき、トウモロコシなどの雑草防除のための除草剤に適しており、産業上有用なものである。

請求の範囲

1. 一般式(1)



[式中、 R^1 、 R^2 は、それぞれ独立して、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} ハロアルキル基、 C_{1-6} ハロアルコキシ基、 C_{1-6} アルキルチオ基、 C_{1-6} アルキルスルフィニル基または C_{1-6} アルキルスルホニル基を示す。

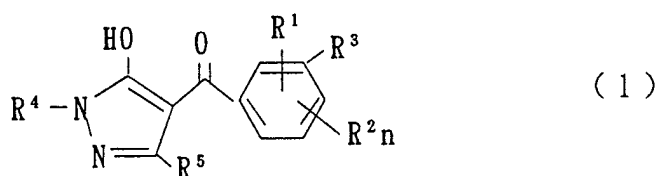
R^3 は、ホルミル基または $CH(ZR^6)_2$ (ここで、 Z は、 O または S を、 R^6 は、 C_{1-6} アルキル基または C_{1-6} ハロアルキル基を示す。)を示す。

R^4 、 R^5 は、それぞれ独立して、水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} ハロアルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基または C_{3-8} シクロアルキル基を示す。

n は、1, 2, 3を示す。]

で表される化合物またはその塩。

2. 一般式(1)



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および n は、前記と同じ意味を示す。)で表される化合物もしくはその塩の1種または2種以上を有効成分として含有することを特徴とする除草剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP98/02573

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
Int.Cl⁶ C07D231/20, A01N43/56

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
Int.Cl⁶ C07D231/20, A01N43/56

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

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

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	JP, 2-173, A (Nissan Chemical Industries, Ltd.), January 5, 1990 (05. 01. 90) & EP, 282944, A & US, 5175299, A	1, 2
Y	JP, 2-131470, A (Nissan Chemical Industries, Ltd.), May 21, 1990 (21. 05. 90) & EP, 344755, A & US, 4942246, A	1, 2
Y	JP, 2-288866, A (Nissan Chemical Industries, Ltd.), November 28, 1990 (28. 11. 90) & EP, 352543, A & US, 4986845, A	1, 2
Y	JP, 7-309869, A (Idemitsu Kosan Co., Ltd.), November 28, 1995 (28. 11. 95) & WO, 9513275, A1 & EP, 728756, A & US, 5756759, A	1, 2

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

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

Date of the actual completion of the international search
August 11, 1998 (11. 08. 98)

Date of mailing of the international search report
August 25, 1998 (25. 08. 98)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl^o C07D231/20, A01N43/56

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl^o C07D231/20, A01N43/56

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

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

WPI/L (QUESTEL)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	J P, 2-173, A (日産化学工業株式会社)、5. 1月. 1990 (05. 01. 90) & EP, 282944, A&US, 5175299, A	1, 2
Y	J P, 2-131470, A (日産化学工業株式会社)、21. 5月. 1990 (21. 05. 90) & EP, 344755, A&US, 4942246, A	1, 2
Y	J P, 2-288866, A (日産化学工業株式会社)、28. 1月. 1990 (28. 11. 90) & EP, 352543, A&US, 4986845, A	1, 2
Y	J P, 7-309869, A (出光興産株式会社)、28. 11月. 1995 (28. 11. 95) & WO, 9513275, A1 & EP, 728756, A&US, 5756759, A	1, 2

C欄の続きにも文献が列挙されている。

パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

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

の日の後に公表された文献

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

国際調査を完了した日

11. 08. 98

国際調査報告の発送日

25.08.98

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)
郵便番号100-8915
東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

佐野 整博



4C 7019

電話番号 03-3581-1101 内線 3452