

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号

特許第7291634号
(P7291634)

(45)発行日 令和5年6月15日(2023.6.15)

(24)登録日 令和5年6月7日(2023.6.7)

(51)国際特許分類

F I

C 0 7 D 207/277 (2006.01)

C 0 7 D 207/277

C S P

A 0 1 N 43/36 (2006.01)

A 0 1 N 43/36

C

A 0 1 N 43/90 (2006.01)

A 0 1 N 43/90

1 0 3

A 0 1 P 13/00 (2006.01)

A 0 1 P 13/00

請求項の数 5 (全91頁)

(21)出願番号 特願2019-566168(P2019-566168)

(86)(22)出願日 平成30年5月30日(2018.5.30)

(65)公表番号 特表2020-522496(P2020-522496
A)

(43)公表日 令和2年7月30日(2020.7.30)

(86)国際出願番号 PCT/US2018/035017

(87)国際公開番号 WO2018/222647

(87)国際公開日 平成30年12月6日(2018.12.6)

審査請求日 令和3年5月25日(2021.5.25)

(31)優先権主張番号 62/512,685

(32)優先日 平成29年5月30日(2017.5.30)

(33)優先権主張国・地域又は機関
米国(US)

(73)特許権者 391022452

エフ エム シー コーポレーション

F M C C O R P O R A T I O N

アメリカ合衆国 1 9 1 0 4 ペンシルベ

ニア州 フィラデルフィア ウォールナッ

トストリート 2 9 2 9

(74)代理人 100127926

弁理士 結田 純次

(74)代理人 100140132

弁理士 竹林 則幸

(72)発明者 マシュー・ジェームズ・キャンベル

アメリカ合衆国ニュージャージー州 0 8

8 2 2 . フレミントン . ウォルナット .

ブルック・ドライブ 5

審査官 阿久津 江梨子

最終頁に続く

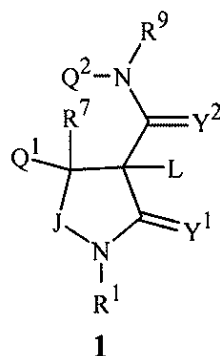
(54)【発明の名称】 除草用 3 - 置換ラクタム

(57)【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 1、その N - オキシド、および塩から選択される化合物

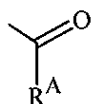
【化 1】



(式中、

L は、

【化 2】



L-1

10

から選択され；

R^A は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_9$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_7$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_9$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_9$ ハロシクロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、

$C_2 \sim C_8$ ハロアルケニル、 $C_1 \sim C_7$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_9$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_9$ ハロジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキルアミノもしくは $C_3 \sim C_9$ ハロシクロアルキルアミノであり、それぞれ、 R^8 もしくは G^1 から独立して選択される3個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または

R^A は、 G^1 もしくは OG^1 であり；または

R^A は、 R^9 と一緒にあって $-C(R^I)(R^J)C(=O)-$ となっており；

20

R^I は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルもしくは $C_1 \sim C_4$ アルキル；またはハロゲンもしくは $C_1 \sim C_4$ アルキルで置換されているまたは非置換のフェニルであり；

R^J は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルもしくは $C_1 \sim C_4$ アルキル；またはハロゲンもしくは $C_1 \sim C_4$ アルキルで置換されているまたは非置換のフェニルであり；

Q^1 は、 R^{10} から独立して選択される4個以下の置換基で置換されているまたは非置換フェニル環であり；または、5～6員複素環式環であり、各環は、炭素原子、ならびに2個以下のO原子、2個以下のS原子および4個以下のN原子から独立して選択される1～4個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、各環は、炭素原子環員上で R^{10} から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で R^{12} から独立して選択される4個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；

30

Q^2 は、 R^{11} から独立して選択される4個以下の置換基で置換されているまたは非置換フェニル環であり；または5～6員複素環式環であり；もしくは8～10員二環式環系であり、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに2個以下のO原子、2個以下のS原子および4個以下のN原子から独立して選択される1～4個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2個以下の炭素環員は $C(=O)$ および $C(=S)$ から独立して選択され、硫黄原子環員は $S(=O)_u(=NR^{14})_v$ から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で R^{11} から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で R^{13} から独立して選択される4個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；

40

Jは、 $-CR^2R^3-$ 、 $-CR^2R^3-CR^4R^5-$ 、 $-NR^6-$ または $-O-$ であり；

Y^1 および Y^2 は、それぞれ独立してO、Sまたは NR^{15} であり；

R^1 は、H、 $C_3 \sim C_8$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニルまたは $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニルであり；

R^2 および R^3 は、それぞれ独立してH、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルもしくは $C_1 \sim C_4$ アルコキシであり；または

R^2 および R^3 は、それらが結合した炭素原子と一緒にあって $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル環

50

を形成しており；

R⁴およびR⁵は、それぞれ独立してH、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキルまたはC₁～C₄アルコキシであり；

R⁶は、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₃～C₆アルキニル もしくはC₁～C₆アルコキシであり；または

R¹およびR⁶は、一緒になってC₃～C₆アルキレンもしくは -CH₂OCH₂- となっており；

R⁷は、H、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルキルまたはC₁～C₄アルキルであり；

各R⁸は、独立してシアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、-CHO、-C(=O)OH、
-C(=O)NH₂、-SO₂NH₂、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₈アルキルカルボニル、C₂～C₈ハロアルキルカルボニル、C₂～C₈アルコキシカルボニル、C₄～C₁₀シクロアルコキシカルボニル、C₅～C₁₂シクロアルキルアルコキシカルボニル、C₂～C₈アルキルアミノカルボニル、C₃～C₁₀ジアルキルアミノカルボニル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₂～C₈アルキルカルボニルオキシ、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆ハロアルキルチオ、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、C₁～C₆アルキルアミノスルホニル、C₂～C₈ジアルキルアミノスルホニル、C₃～C₁₀トリアルキルシリル、C₁～C₆アルキルアミノ、C₂～C₈ジアルキルアミノ、C₂～C₈アルキルカルボニルアミノまたはC₁～C₆アルキルスルホニルアミノであり；

R⁹は、H、ヒドロキシ、アミノ、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₃～C₆アルキニル、C₂～C₈アルコキシアルキル、C₂～C₈ハロアルコキシアルキル、C₂～C₈アルキルチオアルキル、C₂～C₈アルキルスルフィニルアルキル、C₂～C₈アルキルスルホニルアルキル、C₂～C₈アルキルカルボニル、C₂～C₈ハロアルキルカルボニル、C₄～C₁₀シクロアルキルカルボニル、C₂～C₈アルコキシカルボニル、C₂～C₈ハロアルコキシカルボニル、C₄～C₁₀シクロアルコキシカルボニル、C₂～C₈アルキルアミノカルボニル、C₃～C₁₀ジアルキルアミノカルボニル、C₄～C₁₀シクロアルキルアミノカルボニル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆ハロアルキルチオ、C₃～C₈シクロアルキルチオ、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₃～C₈シクロアルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、C₃～C₈シクロアルキルスルホニル、C₁～C₆アルキルアミノスルホニル、C₂～C₈ジアルキルアミノスルホニルまたはC₃～C₁₀トリアルキルシリルまたはG¹であり；

各R¹⁰およびR¹¹は、独立してハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、C₁～C₈アルキル、C₁～C₈シアノアルキル、C₁～C₈シアノアルコキシ、C₁～C₈ハロアルキル、C₁～C₈ヒドロキシアルキル、C₁～C₈ニトロアルキル、C₂～C₈アルケニル、C₂～C₈ハロアルケニル、C₂～C₈ニトロアルケニル、C₂～C₈アルキニル、C₂～C₈ハロアルキニル、C₂～C₈アルコキシアルキル、C₃～C₈アルコキシアルコキシアルキル、C₂～C₈ハロアルコキシアルキル、C₂～C₈ハロアルコキシハロアルコキシ、C₃～C₆シクロアルキル、シクロプロピルメチル、1-メチルシクロプロピル、2-メチルシクロプロピル、C₄～C₁₀シクロアルキルアルキル、C₄～C₁₀ハロシクロアルキルアルキル、C₅～C₁₂アルキルシクロアルキルアルキル、C₅～C₁₂シクロアルキルアルケニル、C₅～C₁₂シクロアルキルアルキニル、C₃～C₈シクロアルキル、C₃～C₈ハロシクロアルキル、C₄～C₁₀アルキルシクロアルキル、C₆～C₁₂シクロアルキルシクロアルキル、C₃～C₈シクロアルケニル、C₃～C₈ハロシクロアルケニル、C₂～C₈ハロアルコキシアルコキシ、C₂～C₈アルコキシアルコキシ、C₄～C₁₀シクロアルコキシアルキル、C₂～C₈アルキルチオアルキル、C₂～C₈アルキルスルフィニルアルキル、C₂～C₈アルキルスルホニルアルキル、C₂～C₈アルキルアミノ、C₂～C₈ジアルキルアミノ、C₂～C₈ハロジアルキルアミノ、C₂～C₈アルキルアミノアルキル、C₂～C₈ハロアルキルアミノアルキル、C₄～C₁₀シクロアルキルアミノアルキル、C₃～C₁₀ジアルキルアミノアルキル、

10

20

30

40

50

- CHO、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $-C(=O)OH$ 、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $-C(=O)NH_2$ 、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ アルキニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ ハロアルキニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ アルキルカルボニルアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニルオキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニル、ホルミルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニルアミノ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルアミノ、 $-SF_5$ 、 $-SCN$ 、 SO_2NH_2 、 $C_3 \sim C_{12}$ トリアルキルシリル、 $C_4 \sim C_{12}$ トリアルキルシリルアルキルまたは $C_4 \sim C_{12}$ トリアルキルシリルアルコキシ；または G^2 ；または $R^{20}S(=O)=N-$ 、 $R^{20}S(=O)_2NR^{19}-C(=O)-$ もしくは $R^{20}(R^{19}N=)qS(=O)p-$ であり、ここで、右に突出している自由結合手は、 Q^1 への結合点を示し；

10

20

各 R^{12} および R^{13} は、独立してシアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ ヒドロキシアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルケニル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_3$ アルキルアミノアルキルまたは $C_3 \sim C_4$ ジアルキルアミノアルキルであり；

各 R^{14} は、独立してH、シアノ、 $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_3$ ハロアルキルカルボニルであり；

各 R^{15} は、独立してH、シアノ、ヒドロキシ、CHO、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $-(C=O)CH_3$ または $-(C=O)CF_3$ であり；

30

各 G^1 は、独立してフェニルであり；または、5もしくは6員複素環式環であり、それぞれ、 R^{17} から独立して選択される5個以下の置換基で環員上で置換されているまたは非置換であり；

各 G^2 は、独立してフェニル、フェニルメチル、ピリジニルメチル、フェニルカルボニル、フェノキシ、フェニルエチニル、フェニルスルホニル、または5もしくは6員複素環式環であり、それぞれ、 R^{18} から独立して選択される5個以下の置換基で環員上で置換されているまたは非置換であり；

各 R^{17} および R^{18} は、独立してハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ 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、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニル、 $C_3 \sim C_{10}$ トリアルキルシリル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルアミノ、フェニル、ピリジニルまたはチ

40

50

エニルであり；

各 R^{19} は、独立して H、シアノ、 $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_3$ ハロアルキルカルボニルであり；

各 R^{20} は、独立して H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシもしくは $C_3 \sim C_{10}$ トリアルキルシリル；または G^1 であり；

各 u および v は、 $S(=O)_u(NR^{14})_v$ の各事例において独立して 0、1 または 2 であり、ただし、 u と v の合計は 0、1 または 2 である；そして

各 p および q は、 $R^{20}(R^{19}N=)_qS(=O)_p$ の各事例において独立して 0、1 または 2 であり、ただし、 p と q の合計は 0、1 または 2 であり、 p が 0 の場合、 q は、1 または 2 以外である。

【請求項 2】

(3S, 4R) - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 3 - (ヒドロキシメチル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピロリジンカルボキサミド(cis)；

(3R, 4S) - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 3 - (ヒドロキシメチル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピロリジンカルボキサミド(trans)；

(3S, 4R) - 3 - [(アセチルオキシ)メチル] - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピロリジネンカルボキサミド；および

(3S, 4R) - 3 - アセチル - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピロリジンカルボキサミド
からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

請求項 1 の化合物と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の成分とを含む、除草用組成物。

【請求項 4】

(a) 請求項 1 の化合物と、(b) (b1) 光学系 I 阻害剤、(b2) アセトヒドロキシ酸シンターゼ(AHAS)阻害剤、(b3) アセチル-CoA カルボキシラーゼ(ACCase)阻害剤、(b4) オーキシン模倣体、(b5) 5 - エノール - ピルビン酸 - 3 - リン酸(EPSP)シンターゼ阻害剤、(b6) 光学系 I 電子ダイバータ、(b7) プロトボルフィリノーゲンオキシダーゼ(PPD)阻害剤、(b8) グルタミンシンターゼ(GS)阻害剤、(b9) 超長鎖脂肪酸(VLCFA)エロンガーゼ阻害剤、(b10) オーキシン輸送阻害剤、(b11) フィトエンデサチュラーゼ(PDS)阻害剤、(b12) 4 - ヒドロキシフェニル - ピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)阻害剤、(b13) ホモゲンチジン酸ソラネシルトランスフェラーゼ(HST)阻害剤、(b14) セルロース生合成阻害剤、(b15) 有糸分裂攪乱物質、有機ヒ素剤、アシュラム、プロモブチド、シンメシリン、クミルロン、ダゾメット、ジフェンゾコート、ダイムロン、エトベンザニド、フルレノール、ホサミン、ホサミン - アンモニウム、ヒダントシジン、メタム、メチルダイムロン、オレイン酸、オキサジクロメフォン、ペラルゴン酸およびピリブチカルブを含む他の除草剤、(b16) 除草剤薬害軽減剤、(b1) ~ (b16) の化合物の塩から選択される少なくとも 1 種の追加の有効成分とを含む、除草用混合物。

【請求項 5】

望ましくない植生の成長を防除する方法であって、植生またはその環境に請求項 1 に記載の化合物の除草有効量を接触させることを含む、前記方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【 0 0 0 1 】

本発明は、特定の除草用 3 - 置換ラクタム、その N - オキシド、塩および組成物、ならびに望ましくない植生の防除のためのそれらの使用方法に関する。

【背景技術】

【 0 0 0 2 】

望ましくない植生の防除は、高い農作物生産効率を達成する上で極めて重要である。とりわけイネ、ダイズ、サトウダイコン、トウモロコシ、ジャガイモ、コムギ、オオムギ、トマト、およびプランテーション農作物のような有用な農作物において雑草の成長の選択的防除を達成することは、殊に望ましい。このような有用な農作物において雑草の成長を放置すると、生産性の大幅な低下をもたらす可能性があり、消費者へのコスト増加という結果を招く可能性がある。非農耕地における望ましくない植生の防除も同様に重要である。この目的のために多くの製品が市販されているが、より効果的で、より安価で、より毒性が低く、より環境に安全であり、または作用部位が異なる新しい化合物に対する必要性は、依然として存在する。特許文献 1、特許文献 2 および特許文献 3 は、除草剤としての環状アミドを開示している。本発明の化合物は、これらの公開公報に記載の化合物とは異なるものである。本発明の除草用 3 - 置換ラクタムは、これらの公報には開示されていない。

10

【先行技術文献】

【特許文献】

【 0 0 0 3 】

20

【文献】WO 2 0 1 5 / 0 8 4 7 9 6

WO 2 0 1 6 / 0 0 3 9 9 7

WO 2 0 1 6 / 1 9 6 5 9 3

【発明の概要】

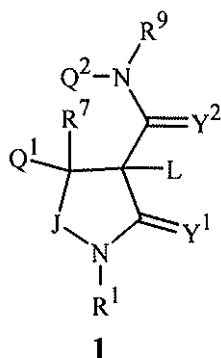
【課題を解決するための手段】

【 0 0 0 4 】

本開示は、一つには、式 1 の化合物（全ての立体異性体を含む）、そうした化合物の N - オキシド、ならびにそうした化合物および N - オキシドの塩に関する：

【化 1 】

30



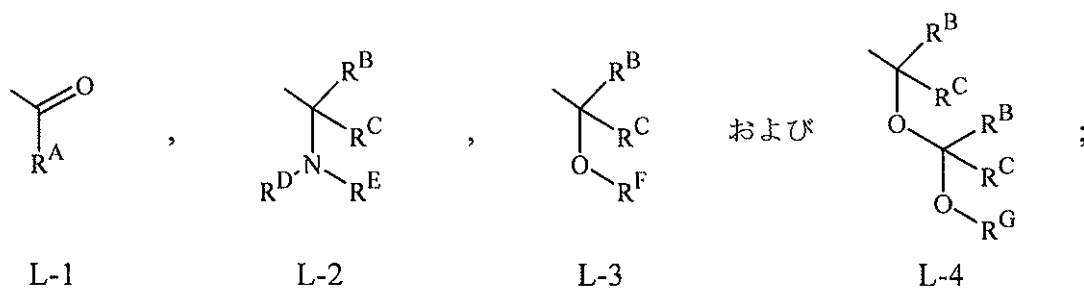
40

（式中、

L は、

50

【化 2】



10

から選択され；

R^A は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_9$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_7$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_9$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_9$ ハロシクロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニル、 $C_1 \sim C_7$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_9$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_9$ ハロジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキルアミノもしくは $C_3 \sim C_9$ ハロシクロアルキルアミノであり、それぞれ、 R^8 もしくは G^1 から独立して選択される3個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり置換されているまたは非置換であり；または

20

R^A は、 G^1 もしくは OG^1 であり；または

R^A は、 R^9 と一緒にあって $-C(R^I)(R^J)C(=O)-$ となっており（即ち、環を形成しており）；

R^B は、 H 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルもしくは $C_1 \sim C_4$ アルキル；またはハロゲンもしくは $C_1 \sim C_4$ アルキルで置換されているまたは非置換のフェニルであり；

R^C は、 H 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルもしくは $C_1 \sim C_4$ アルキル；またはハロゲンもしくは $C_1 \sim C_4$ アルキルで置換されているまたは非置換のフェニルであり；

R^D は、 H 、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニルであり；

30

R^E は、 H 、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、ホルミル、 $-C(O)NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニルまたは $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニル；または G^E もしくは $W^E G^E$ であり；

40

R^F は、 H 、ホルミル、 $-C(O)NH_2$ 、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アル

50

キルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニル、 $-P(=O)(OH)_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルホスホリル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルホスホリル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルホスホリル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルコキシホスホリル、 $C_6 \sim C_{14}$ ジシクロアルコキシホスホリル、 $C_8 \sim C_{16}$ ジシクロアルキルアルコキシホスホリル、 $C_2 \sim C_{12}$ ビス(アルキルアミノ)ホスホリル、 $C_4 \sim C_{24}$ ビス(ジアルキルアミノ)ホスホリル；または G^F もしくは $W^F G^F$ であり；

R^G は、ホルミル、 $-C(O)NH_2$ 、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニル、 $-P(=O)(OH)_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルホスホリル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルホスホリル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルホスホリル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルコキシホスホリル、 $C_6 \sim C_{14}$ ジシクロアルコキシホスホリル、 $C_8 \sim C_{16}$ ジシクロアルキルアルコキシホスホリル、 $C_2 \sim C_{12}$ ビス(アルキルアミノ)ホスホリル、 $C_4 \sim C_{24}$ ビス(ジアルキルアミノ)ホスホリル；または R^{16} で置換されているまたは非置換のフェニル；または $W^G G^G$ であり；

R^I は、 H 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルもしくは $C_1 \sim C_4$ アルキル；またはハロゲンもしくは $C_1 \sim C_4$ アルキルで置換されているまたは非置換のフェニルであり；

R^J は、 H 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルもしくは $C_1 \sim C_4$ アルキル；またはハロゲンもしくは $C_1 \sim C_4$ アルキルで置換されているまたは非置換のフェニルであり；

Q^1 は、フェニル環もしくはナフタレニル環系であり、各環もしくは環系は、 R^7 から独立して選択される5個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または、4～7員複素環式環；もしくは8～10員二環式環系であり、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに2個以下のO原子、2個以下のS原子および5個以下のN原子から独立して選択される1～5個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、3個以下の炭素環員は $C(=O)$ および $C(=S)$ から独立して選択され、硫黄原子環員は $S(=O)_u(=NR^{14})_v$ から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で R^{10} から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で R^{12} から独立して選択される5個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または

Q^2 は、フェニル環もしくはナフタレニル環系であり、各環もしくは環系は、 R^{10} から独立して選択される5個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または、4～7員複素環式環；もしくは8～10員二環式環系であり、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに2個以下のO原子、2個以下のS原子および5個以下のN原子から独立して選択される1～4個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、3個以下の炭素環員は $C(=O)$ および $C(=S)$ から独立して選択され、硫黄原子環員は $S(=O)_u(=NR^{14})_v$ から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で R^{11} から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で R^{13} から独立して選択される5個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または

J は、 $-CR^2R^3-$ 、 $-CR^2R^3-CR^4R^5-$ 、 $-NR^6-$ または $-O-$ であり；

Y^1 および Y^2 は、それぞれ独立してO、Sまたは NR^{15} であり；

R^1 は、 H 、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、ホルミル、 $C_3 \sim C_8$ アルキルカルボニルアルキル、 $-C(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})=N-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ 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、 $C_3 \sim C_6$ アル

10

20

30

40

50

キニル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニル、 $C_3 \sim C_{10}$ トリアルキルシリル；または $-CPh=N-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、それぞれ、 R^{13} から独立して選択される 5 個以下の置換基で環員上で置換されているまたは非置換であり；または G^1 であり；

10

R^2 および R^3 は、それぞれ独立して H、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルもしくは $C_1 \sim C_4$ アルコキシであり；または

R^2 および R^3 は、それらが結合した炭素原子と一緒に becoming $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル環を形成しており；

20

R^4 および R^5 は、それぞれ独立して H、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_4$ アルコキシであり；

R^6 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルもしくは $C_1 \sim C_6$ アルコキシであり；または

R^1 および R^6 は、一緒に becoming $C_3 \sim C_6$ アルキレンもしくは $-CH_2OCH_2-$ となっており；

R^7 は、H、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

各 R^8 は、独立してシアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)O$ H、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニル、 $C_3 \sim C_{10}$ トリアルキルシリル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルアミノまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルアミノであり；

30

40

R^9 は、H、ヒドロキシ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ 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、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルチオ、 $C_1 \sim C$

50

₆ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニルまたは $C_3 \sim C_{10}$ トリアルキルシリルまたは G^1 であり；

各 R^{10} および R^{11} は、独立してハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_8$ シアノアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ ヒドロキシアルキル、 $C_1 \sim C_8$ ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ニトロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、シクロプロピルメチル、1 - メチルシクロプロピル、2 - メチルシクロプロピル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルケニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_6 \sim C_{12}$ シクロアルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ハロジアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルアミノアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノアルキル、 $-CHO$ 、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $-C(=O)OH$ 、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $-C(=O)NH_2$ 、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ アルキニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ ハロアルキニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ アルキルカルボニルアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニルオキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニル、ホルミルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニルアミノ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルアミノ、 $-SF_5$ 、 $-SCN$ 、 SO_2NH_2 、 $C_3 \sim C_{12}$ トリアルキルシリル、 $C_4 \sim C_{12}$ トリアルキルシリルアルキルまたは $C_4 \sim C_{12}$ トリアルキルシリルアルコキシ；または G^2 ；または $R^{20}S(=O)=N-$ 、 $R^{20}S(=O)_2NR^{19}-C(=O)-$ もしくは $R^{20}(R^{19}N=)qS(=O)p-$ であり、ここで、右に突出している自由結合手は、 Q^1 への結合点を示し；または

各 R^{12} および R^{13} は、独立してシアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ ヒドロキシアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルケニル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_3$ アルキルアミノアルキルまたは $C_3 \sim C_4$ ジアルキルアミノアルキルであり；

各 R^{14} は、独立してH、シアノ、 $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_3$ ハロ

10

20

30

40

50

アルキルカルボニルであり；

各 R^{15} は、独立して H、シアノ、ヒドロキシ、CHO、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $-(C=O)CH_3$ または $-(C=O)CF_3$ であり；

各 G^1 は、独立してフェニルであり；または、5 もしくは 6 員複素環式環であり、それぞれ、 R^{17} から独立して選択される 5 個以下の置換基で環員上で置換されているまたは非置換であり；

各 W^E 、 W^F および W^G は、独立して $-C(=O)-$ 、 $-C(=O)O-$ 、 $-C(=O)NH-$ または $-S(=O)_2-$ であり；

各 G^E 、 G^F および G^G は、独立して R^{16} で置換されているまたは非置換のフェニルであり；または 5 もしくは 6 員複素環式環であり、各複素環式環は、 R^{16} から独立して選択される 5 個以下の置換基で環員上で置換されているまたは非置換であり；

各 G^2 は、独立してフェニル、フェニルメチル（即ち、ベンジル）、ピリジニルメチル、フェニルカルボニル（即ち、ベンゾイル）、フェノキシ、フェニルエチニル、フェニルスルホニル、または 5 もしくは 6 員複素環式環であり、それぞれ、 R^{18} から独立して選択される 5 個以下の置換基で環員上で置換されているまたは非置換であり；

各 R^{16} 、 R^{17} および R^{18} は、独立してハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ 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、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニル、 $C_3 \sim C_{10}$ トリアルキルシリル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルアミノ、フェニル、ピリジニルまたはチエニルであり；

各 R^{19} は、独立して H、シアノ、 $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_3$ ハロアルキルカルボニルであり；

各 R^{20} は、独立して H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシもしくは $C_3 \sim C_{10}$ トリアルキルシリル；または G^1 であり；

各 u および v は、 $S(=O)_u(NR^{14})_v$ の各事例において独立して 0、1 または 2 であり、ただし、 u と v の合計は 0、1 または 2 であり；

各 p および q は、 $R^{20}(R^{19}N=)_qS(=O)_p-$ の各事例において独立して 0、1 または 2 であり、ただし、 p と q の合計は 0、1 または 2 であり、 p が 0 の場合、 q は、1 または 2 以外である）。

【0005】

より詳細には、本発明は、式 1 の化合物（全ての立体異性体を含む）、その N - オキシドまたは塩に関する。本発明は更に、本発明の化合物（即ち、除草有効量の）と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の成分を含む除草用組成物に関する。本発明は更に、植生またはその環境に本発明の化合物（例えば、本明細書に記載する組成物としての）の除草有効量を接触させることを含む、望ましくない植生の成長を防除する方法に関する。

【0006】

10

20

30

40

50

本発明は更に、一つには、以下に記載するように、(a)式1から選択される化合物、そのN-オキシドおよび塩と、(b)(b1)~(b16);および(b1)~(b16)の化合物の塩から選択される少なくとも1種の追加の有効成分とを含む除草用混合物を含む。

【発明を実施するための形態】

【0007】

本明細書において使用する場合、「含む(comprises)」、「含む(comp^rising)」、「含む(includes)」、「含む(including)」、「有する(has)」、「有する(having)」、「含有する(contains)」、「含有する(containing)」、「特徴とする(characterized by)」という用語またはそれらの任意の他の変形は、明示的に示された制限に従って非排他的包摂を包含することを意図している。例えば、列挙した要素を含む組成物、混合物、プロセス、または方法は、必ずしもそれらの要素に限定されるものではなく、明確に列挙されていない他の要素、またはそうした組成物、混合物、プロセス、または方法に特有な他の要素を含んでもよい。

【0008】

「からなる(consisting of)」という移行句は、指定されていない要素、工程、または原材料を除外する。請求項の中にある場合、そうした移行句は、請求項が、通常それに付随する不純物を除く、記載されたもの以外の材料を包含しないことを意味する。「からなる」という句が、プリアンブルの直後ではなく、請求項の本文の分節に出てきた場合、その分節に記載された要素のみを限定し、他の要素は、全体としてその請求項から除外されない。

【0009】

「本質的に~からなる(consisting essentially of)」という移行句は、文字通り開示されたものに追加の材料、工程、特徴物、成分、または要素を含む組成物または方法を定義するために使用される。ただし、これら追加の材料、工程、特徴物、成分、または要素は、特許請求される発明の基本的な特性および新規な特性に実質的に影響を及ぼさない。「本質的に~からなる」という用語は、「含む(comp^rising)」と「からなる(consisting of)」の中間の地位を占める。

【0010】

出願人が、発明またはその一部を「含む」のようなオープンエンドの用語を用いて定義していた場合、記載が(別段の記載がない限り)、そうした発明を「本質的に~からなる」または「からなる」という用語を使用して説明しているとも解釈すべきであることは、容易に理解されるべきである。

【0011】

更に、反対のことが明示的に述べられていない限り、「または」は、排他的「または」ではなく包括的「または」を意味する。例えば、条件AまたはBは、以下のいずれかによって満たされる：Aが真であり(または存在する)Bが偽である(または存在しない)、Aが偽であり(または存在しない)Bが真である(または存在する)、およびAとBがどちらも真である(または存在する)。

【0012】

また、本発明の要素または成分に先行する不定冠詞「a」および「an」は、その要素または成分の事例(即ち、発生)の数に関して非制限的であることを意図している。したがって、「a」または「an」は、1つまたは少なくとも1つを含むものとして読み取るべきであり、要素または成分の単語の単数形は、その数が明らかに単数を意図していない限り、複数も含む。

【0013】

本明細書において言及している場合、単独で、または単語の組合せにおいて使用される「実生」という用語は、種子の胚から成長している若い植物を意味する。

【0014】

10

20

30

40

50

本明細書において言及している場合、単独で、または「広葉雑草」のような言葉の中で使用される「広葉」という用語は、2枚の子葉を持つ胚を特徴とする被子植物の群を説明するために使用される用語である双子葉植物または双子葉類を意味する。

【0015】

本明細書において使用する場合、「アルキル化剤」という用語は、炭素含有ラジカルが炭素原子を介してハライドまたはスルホナートのような脱離基に結合し、求核試薬の前記炭素原子への結合によって置き換え可能な化合物を指す。別段の指示がない限り、「アルキル化」という用語は、炭素含有ラジカルをアルキルに限定しない。

【0016】

上記の記述において、単独で、または「アルキルチオ」もしくは「ハロアルキル」のような複合語において使用される「アルキル」という用語は、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、または異なるブチル、ペンチルもしくはヘキシル異性体のような、直鎖または分枝アルキルを含む。「アルケニル」は、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、ならびに異なるブテニル、ペンテニルおよびヘキセニル異性体のような、直鎖または分枝アルケンを含む。「アルケニル」は、1, 2-プロパジエニルおよび2, 4-ヘキサジエニルのようなポリエンを更に含む。「アルキニル」は、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、ならびに異なるブチニル、ペンチニルおよびヘキシニル異性体のような、直鎖または分枝アルキンを含む。「アルキニル」は、2, 5-ヘキサジイニルのような複数の三重結合で構成される部分を更に含むことができる。「アルキレン」は、直鎖または分枝アルカンジイルを表す。「アルキレン」の例としては、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$ および異なるブチレン、ペンチレンおよびヘキシレン異性体が挙げられる。

【0017】

「アルコキシ」は、例えば、メトキシ、エトキシ、n-プロピルオキシ、イソプロピルオキシ、ならびに異なるブトキシ、ペントキシおよびヘキシルオキシ異性体を含む。「アルコキシアルキル」は、アルキル上でのアルコキシ置換を表す。「アルコキシアルキル」の例としては、 CH_3OCH_2 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ が挙げられる。「アルコキシアルコキシアルキル」は、少なくともアルコキシアルキル部分のアルコキシ部分上でのアルコキシ置換を表す。「アルコキシアルコキシアルキル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{OCH}_2$ -、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_3)\text{CHOCH}_2$ - および $(\text{CH}_3\text{O})_2\text{CHOCH}_2$ - が挙げられる。「アルコキシアルコキシ」は、アルコキシ上でのアルコキシ置換を表す。アルコキシアルコキシの例としては、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}$ が挙げられる。「アルケニルオキシ」は、直鎖または分枝アルケニルオキシ部分を含む。「アルケニルオキシ」の例としては、 $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}$ および $\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ が挙げられる。「アルキニルオキシ」は、直鎖または分枝アルキニルオキシ部分を含む。「アルキニルオキシ」の例としては、 $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ 、 $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ および $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ が挙げられる。「アルキルチオ」は、メチルチオ、エチルチオ、ならびに異なるプロピルチオ、ブチルチオ、ペンチルチオおよびヘキシルチオ異性体のような、分枝または直鎖アルキルチオ部分を含む。「アルキルスルフィニル」は、アルキルスルフィニル基の両方のエナンチオマーを含む。「アルキルスルフィニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})$ -、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ -、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ -、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})$ -、ならびに異なるブチルスルフィニル、ペンチルスルフィニルおよびヘキシルスルフィニル異性体が挙げられる。「アルキルスルホニル」は、直鎖または分枝アルキル基で置換されたスルホニル部分を表す。「アルキルスルホニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2$ -、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ -、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ -、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2$ -、ならびに異なるブチルスルホニル、ペンチルスルホニルおよびヘキシルスルホニル異性体が挙げられる。「アルキルチオアルキル」は、アルキル上でのアルキルチオ置換を表

10

20

30

40

50

す。「アルキルチオアルキル」の例としては、 CH_3SCH_2 、 $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ が挙げられる。「アルキルスルフィニルアルキル」は、アルキル上でのアルキルスルフィニル置換を表す。「アルキルスルフィニルアルキル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2$ が挙げられる。「アルキルスルホニルアルキル」は、アルキル上でのアルキルスルホニル置換を表す。「アルキルスルホニルアルキル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ が挙げられる。「アルキルスルホニルオキシ」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ が挙げられる。「アルキルアミノ」、「ジアルキルアミノ」、「ハロジアルキルアミノ」などは、上記の例と同様に定義される。「アルキルスルホニルアミノ」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})\text{NH}-$ および $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})\text{NH}-$ が挙げられる。「アルキルアミノアルキル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{NHCH}_2-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHCH}_2-$ および $\text{CH}_3\text{NHCH}(\text{CH}_3)-$ が挙げられる。「ジアルキルアミノアルキル」の例としては、 $(\text{CH}_3)_2\text{NCH}_2-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(\text{CH}_3)\text{H}-$ および $(\text{CH}_3)(\text{CH}_3)\text{NCH}_2-$ が挙げられる。「アルキルアミノカルボニル」の例としては、 $(\text{CH}_3)\text{NHC}(\text{O})-$ および $(\text{CH}_3\text{CH}_2)\text{NHC}(\text{O})-$ が挙げられる。「ジアルキルアミノカルボニル」の例は、 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(\text{O})-$ である。「アルキルアミノスルホニル」の例は、 $(\text{CH}_3)\text{NHS}(\text{O})_2-$ であり、「ジアルキルアミノスルホニル」の例は、 $(\text{CH}_3)_2\text{NS}(\text{O})_2-$ である。「アルキルカルボニルアミノ」という用語は、カルボニルアミノ基の $\text{C}(=\text{O})$ 部分に結合した直鎖または分枝アルキル部分を表す。「アルキルカルボニルアミノ」の例としては、 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})\text{NH}-$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NH}-$ が挙げられる。「アルコキシカルボニルアミノ」という用語は、カルボニルアミノ基の $\text{C}(=\text{O})$ 部分に結合した直鎖または分枝アルコキシ部分を表す。「アルコキシカルボニルアミノ」の例としては、 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})\text{NH}-$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{NH}-$ が挙げられる。

【0018】

「シクロアルキル」は、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルを含む。「アルキルシクロアルキル」という用語は、シクロアルキル部分上でのアルキル置換を表し、例えば、エチルシクロプロピル、*i*-プロピルシクロブチル、3-メチルシクロペンチルおよび4-メチルシクロヘキシルを含む。「シクロアルキルアルキル」という用語は、アルキル部分上でのシクロアルキル置換を表す。「シクロアルキルアルキル」の例としては、シクロプロピルメチル、シクロペンチルエチル、および直鎖または分枝アルキル基に結合した他のシクロアルキル部分が挙げられる。「アルキルシクロアルキルアルキル」という用語の例としては、1-メチルシクロプロピルメチルおよび2-メチルシクロペンチルエチルが挙げられる。「シクロアルキルアルケニル」という用語は、アルケニル部分に結合したシクロアルキルを表す。「シクロアルキルシクロアルキル」という用語は、単結合によるシクロアルキル部分上でのシクロアルキル置換を表す。「シクロアルキルアルキニル」という用語は、アルキニル部分に結合したシクロアルキルを表す。「シクロアルキルアミノ」という用語は、アミノ部分に結合したシクロアルキルを表す。「シクロアルキルアミノカルボニル」という用語は、アミノカルボニル部分に結合したシクロアルキルを表す。「シクロアルキルアミノアルキル」という用語は、アミノアルキル部分に結合したシクロアルキルを表す。「シクロアルキルカルボニル」という用語は、カルボニル部分に結合したシクロアルキルを表す。「シクロアルキルカルボニルアルキル」という用語は、カルボニルアルキル部分に結合したシクロアルキルを表す。「シクロアルキルカルボニルオキシ」という用語は、カルボニルオキシ部分の炭素原子に結合したシクロアルキルを表す。「シクロアルコキシ」という用語は、シクロペンチルオキシおよびシクロヘキシルオキシのような、酸素原子を介して結合したシクロアルキルを表す。「シクロアルコキシアルキル」という用語は、アルキル部分を介して結合したシク

ロアルコキシを表す。「シクロアルキルチオ」、「シクロアルキルスルフィニル」および「シクロアルキルスルホニル」という用語は、それぞれ硫黄、スルフィニルまたはスルホニル部分を介して結合したシクロアルキルを表す。

【0019】

「シクロアルコキシカルボニル」という用語は、カルボニル部分を介して結合したシクロアルコキシを表す。「シクロアルキルアルコキシ」は、アルキル鎖に結合した酸素原子を介して結合したシクロアルキルアルキルを表す。「シクロアルキルアルコキシ」の例としては、シクロプロピルメトキシ、シクロペンチルエトキシ、および直鎖または分枝アルコキシ基に結合した他のシクロアルキル部分が挙げられる。「シクロアルケニル」は、シクロペンテニルおよびシクロヘキセニルのような基に加えて、1, 3 - および 1, 4 - シクロヘキサジエニルのような 2 つ以上の二重結合を有する基を含む。「ハロシクロアルケニル」という用語は、シクロアルケニル部分上でのハロゲン置換を表す。

【0020】

「ハロゲン」という用語は、単独で、もしくは「ハロアルキル」のような複合語において、または「ハロゲンで置換されているアルキル」のような記載において使用される場合、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を含む。更に、「ハロアルキル」のような複合語において使用される場合、または「ハロゲンで置換されているアルキル」のような記載において使用される場合、前記アルキルは、同一であっても異なってもよいハロゲン原子で部分的にまたは完全に置換されていてもよい。「ハロアルキル」または「ハロゲンで置換されているアルキル」の例としては、 F_3C 、 $ClCH_2$ 、 CF_3CH_2 および CF_3CCl_2 が挙げられる。「ハロシクロアルキル」、「ハロシクロアルキルアルキル」、「ハロシクロアルコキシ」、「ハロアルコキシ」、「ハロアルコキシアルコキシ」、「ハロアルキルチオ」、「ハロアルキルスルフィニル」、「ハロアルキルスルホニル」、「ハロアルケニル」、「ハロアルキニル」、「ハロアルケニルオキシ」、「ハロアルケニルアルキル」、「ハロアルキルカルボニル」、「ハロアルキルカルボニルアミノ」、「ハロアルキルスルホニルアミノ」、「ハロアルコキシハロアルコキシ」、「ハロアルキルスルホニルオキシ」、「ハロアルキニルオキシ」、「ハロアルコキシアルキル」、「ハロアルキルカルボニルオキシ」、「ハロアルキルアミノアルキル」などの用語は、「ハロアルキル」という用語と同様に定義される。「ハロアルコキシ」の例としては、 CF_3O- 、 CCl_3CH_2O- 、 $HCF_2CH_2CH_2O-$ および CF_3CH_2O- が挙げられる。「ハロアルキルチオ」の例としては、 CCl_3S- 、 CF_3S- 、 CCl_3CH_2S- および $ClCH_2CH_2CH_2S-$ が挙げられる。「ハロアルキルスルフィニル」の例としては、 $CF_3S(O)-$ 、 $CCl_3S(O)-$ 、 $CF_3CH_2S(O)-$ および $CF_3CF_2S(O)-$ が挙げられる。「ハロアルキルスルホニル」の例としては、 $CF_3S(O)_2-$ 、 $CCl_3S(O)_2-$ 、 $CF_3CH_2S(O)_2-$ および $CF_3CF_2S(O)_2-$ が挙げられる。「ハロアルキルスルホニルオキシ」の例としては、 $CHCl_2S(O)_2O-$ 、 $CH_2ClCH_2S(O)_2O-$ および $CH_3CHClCH_2S(O)_2O-$ が挙げられる。「ハロアルケニル」の例としては、 $(Cl)_2C=CHCH_2-$ および $CF_3CH_2CH=CHCH_2-$ が挙げられる。「ハロアルケニルオキシ」の例としては、 $(Cl)_2C=CHCH_2O-$ および $CF_3CH_2CH=CHCH_2O-$ が挙げられる。「ハロアルキニル」の例としては、 $HC(C)CHCl-$ 、 $CF_3C(C)-$ 、 $CCl_3C(C)-$ および $FCH_2C(C)CH_2-$ が挙げられる。「ハロアルキニルオキシ」の例としては、 $HC(C)CHClO-$ 、 $CCl_3C(C)-$ および $FCH_2C(C)CH_2O-$ が挙げられる。「ハロアルコキシアルキル」の例としては、 CF_3OCH_2- 、 $ClCH_2CH_2OCH_2CH_2-$ 、 $Cl_3CCH_2OCH_2-$ に加えて、分枝アルキル誘導体が挙げられる。「ハロアルコキシカルボニル」の例としては、 $CF_3OC(O)-$ 、 $ClCH_2CH_2OCH_2CH_2-$ 、 $Cl_3CCH_2OC(O)-$ に加えて、分枝アルキル誘導体が挙げられる。

【0021】

「アルキルカルボニル」は、 $C(=O)$ 部分に結合した直鎖または分枝アルキル部分を表す。「アルコキシカルボニル」は、 $C(=O)$ 部分に結合した直鎖または分枝アルコキ

10

20

30

40

50

シ部分を表す。「アルキルカルボニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$ および $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})-$ が挙げられる。「アルコキシカルボニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})-$ および異なるブトキシまたはペンタオキシカルボニル異性体が挙げられる。「シクロアルキルアルコキシカルボニル」は、アルコキシカルボニル部分の酸素原子に結合したシクロアルキルアルキル部分を表す。「シクロアルキルアルコキシカルボニル」の例としては、シクロプロピル- $\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ 、シクロプロピル- $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{OC}(=\text{O})-$ およびシクロペンチル- $\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ が挙げられる。「アルキルカルボニルアルキル」は、カルボニルアルキル部分の炭素原子に結合した直鎖または分枝鎖アルキル基を表す。「アルキルカルボニルアルキル」の例としては、 $(\text{CH}_3)\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$ および $(\text{CH}_3\text{CH}_2)\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$ が挙げられる。「アルキルカルボニルオキシ」は、カルボニルオキシ部分の炭素原子に結合した直鎖または分枝鎖アルキル基を表す。「アルキルカルボニルオキシ」の例としては、 $(\text{CH}_3)\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ および $(\text{CH}_3\text{CH}_2)\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ が挙げられる。

【0022】

「ジアルキルホスホリル」という用語は、ホスフィンオキシド誘導体を指す。「ジアルキルホスホリル」の例としては、 $-\text{P}(=\text{O})(\text{CH}_3)_2$ および $-\text{P}(=\text{O})(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$ が挙げられる。「ハロアルキルホスホリル」という用語は、ハロゲン化ホスフィンオキシド誘導体を指す。「ハロアルキルホスホリル」の例としては、 $\text{P}(=\text{O})(\text{CH}_2\text{Cl})_2$ および $-\text{P}(=\text{O})(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Br})_2$ および $-\text{P}(=\text{O})(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_2)_2$ が挙げられる。「シクロアルキルホスホリル」という用語は、シクロアルキルホスフィンオキシド誘導体を指す。「シクロアルキルホスホリル」の例としては、 $-\text{P}(=\text{O})(\text{c-Pr})_2$ および $-\text{P}(=\text{O})(\text{c-hex})_2$ が挙げられる。「ジアルコキシホスホリル」という用語は、ホスホン酸誘導体を指す。「ジアルコキシホスホリル」の例としては、 $-\text{P}(=\text{O})(\text{OCH}_3)_2$ および $-\text{P}(=\text{O})(\text{OCH}_2\text{CH}_3)_2$ が挙げられる。「ジシクロアルキルアルコキシホスホリル」という用語は、ホスホン酸誘導体を指す。「ジシクロアルキルアルコキシホスホリル」の例としては、 $-\text{P}(=\text{O})(\text{O-c-Pr})_2$ および $-\text{P}(=\text{O})(\text{O-c-Bu})_2$ が挙げられる。ビス(アルキルアミノ)ホスホリルの例としては、 $-\text{P}(=\text{O})(\text{NHCH}_3)_2$ および $-\text{P}(=\text{O})(\text{NHCH}_2\text{CH}_3)_2$ が挙げられる。ビス(ジアルキルアミノ)ホスホリルの例としては、 $-\text{P}(=\text{O})(\text{N}(\text{CH}_3)_2)_2$ および $-\text{P}(=\text{O})(\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)_2)_2$ が挙げられる。

【0023】

「シアノアルキル」または「シアノアルコキシ」という用語は、それぞれアルキルまたはアルコキシ部分を介して結合したシアノ基を意味する。シアノ基中の炭素は、この用語についての炭素原子の総数に含まれない。「ニトロアルキル」または「ニトロアルケニル」という用語は、それぞれアルキルまたはアルケニル部分を介して結合したニトロ基を表す。「ヒドロキシアルキル」という用語は、アルキル部分を介して結合したヒドロキシル基を意味する。「トリアルキルシリル」という用語は、ケイ素を介して結合した3つのアルキル基を意味する。「トリアルキルシリルアルキル」という用語は、シリルアルキル部分を介して結合した3つのアルキル基を意味する。「トリアルキルシリルアルコキシ」という用語は、シリルアルコキシ部分を介して結合した3つのアルキル基を意味する。

【0024】

置換基中の炭素原子の総数は、「 $\text{C}_i \sim \text{C}_j$ 」という接頭辞によって表され、ここで、 i および j は、1～24の数である。例えば、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルスルホニルは、メチルスルホニル～ブチルスルホニルを指定し； C_2 アルコシアルキルは、 CH_3OCH_2- を指定し； C_3 アルコシアルキルは、例えば、 $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)-$ 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ または $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ を指定し； C_4 アルコシアルキルは、全部で4個の炭素原子を含有するアルコキシ基で置換されたアルキル基の様々な異性体を指定し、そ

の例としては、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ が挙げられる。

【0025】

置換基の数が1を超えることがあることを示す下付き文字を伴う置換基で化合物が置換されている場合、前記置換基は(1を超える場合)、定義された置換基の群(例えば、 $(\text{R}^7)_n$ 、 n は1、2、3、4または5である)から独立して選択される。基が、水素とすることができる置換基、例えば R^2 または R^3 を含有する場合、この置換基が水素とされる場合には、これは、前記基が未置換であることと等しいと認識される。可変基が場合によりある位置に結合していると示されている場合、例えば $(\text{R}^7)_n$ の n が0であり得る場合、可変基の定義に記載されていなくても、水素がその位置にあってもよい。ある基上の1つまたはそれ以上の位置が「置換されていない」または「非置換」と記載される場合、水素原子が結合して任意の自由原子価を取る。

10

【0026】

原子の環に関する「完全飽和」という表現は、環の原子間の結合が全て単結合であることを意味する。環に関する「完全不飽和」という表現は、環中の原子間の結合が、原子価結合理論に従って単結合または二重結合であり、更に、環中の原子間の結合が、二重結合が累積的であることなく(即ち、 $\text{C}=\text{C}=\text{C}$ 、 $\text{N}=\text{C}=\text{C}$ などを含まず)、可能な限り多くの二重結合を含むことを意味する。環に関する「部分不飽和」という用語は、隣接する環員に二重結合を介して結合した少なくとも1つの環員を含み、概念的には、存在する二重結合(即ち、その部分不飽和形態での)の数よりも多くの非累積二重結合(即ち、その完全不飽和相当形態での)を隣接する環員を介して潜在的に収容する環を表す。完全不飽和環がヒュッケルの法則を満たす場合、これは、芳香族と記載することもできる。

20

【0027】

別段の指示がない限り、式1の成分としての「環」または「環系」(例えば、置換基 Q^1)は、炭素環式または複素環式である。「環系」という用語は、2つ以上の縮合した環を表す。「二環式環系」および「縮合二環式環系」という用語は、2つの縮合した環からなる環系を表し、別段の指示がない限り、いずれの環も飽和、部分不飽和、または完全不飽和であり得る。「縮合複素二環式環系」という用語は、少なくとも1つの環原子が炭素ではない縮合した二環式環系を表す。「環員」という用語は、環または環系の骨格を形成している原子または他の部分(例えば、 $\text{C}(=\text{O})$ 、 $\text{C}(=\text{S})$ 、 $\text{S}(=\text{O})$ または $\text{S}(=\text{O})_2$)を指す。

30

【0028】

「炭素環式環」、「炭素環」または「炭素環式環系」という用語は、環骨格を形成している原子が炭素のみから選択される環または環系を表す。別段の指示がない限り、炭素環式環は、飽和、部分不飽和、または完全不飽和の環であり得る。完全不飽和の炭素環式環がヒュッケル則を満たす場合、前記環は、「芳香族環」とも呼ばれる。「飽和炭素環式」は、互いに単結合で結合した炭素原子からなる骨格を有する環を指し; 特別の定めがない限り、残りの炭素の原子価は、水素原子によって占められる。

【0029】

「複素環式環」、「複素環」または「複素環式環系」という用語は、環骨格を形成している少なくとも1個の原子が炭素ではなく、例えば、窒素、酸素または硫黄である環または環系を表す。典型的には、複素環式環は、5個以下の窒素、2個以下の酸素、および2個以下の硫黄を含有する。別段の指示がない限り、複素環式環は、飽和、部分不飽和、または完全不飽和の環であり得る。完全不飽和の複素環式環がヒュッケル則を満たす場合、前記環は、「複素芳香族環」または「芳香族複素環式環」とも呼ばれる。別段の指示がない限り、複素環式環および環系は、任意の利用可能な炭素または窒素を介し、前記炭素または窒素上の水素の置換によって結合することが可能である。

40

【0030】

「芳香族」は、環原子のそれぞれが本質的に同一平面上にあり、環平面に垂直な p 軌道を有すること、および $(4n+2)$ 個(n は正の整数)の電子が環と関連してヒュッケ

50

ル則に従うことを指す。「芳香族環または環系」という用語は、環または環系の少なくとも1つの環が芳香族である炭素環式または複素環式環または環系を表す。「芳香族環または環系」という用語は、「アリアル」とも呼ばれる。「芳香族複素環式環系」という用語は、環系の少なくとも1つの環が芳香族である複素環式環系を表す。「非芳香族環系」という用語は、完全飽和だけでなく、部分的にまたは完全に不飽和であり得るが、ただし、環系内のどの環も芳香族ではない炭素環式または複素環式環系を表す。「非芳香族炭素環式環系」という用語は、環系内の環がいずれも芳香族ではない炭素環式環系を表す。「非芳香族複素環式環系」という用語は、環系内の環がいずれも芳香族ではない複素環式環系を表す。

【0031】

10

複素環式環に関する「置換されているまたは非置換の」または「場合により置換されている」という用語は、非置換であるか、または非置換の類似体が有する生物学的活性を消失させない少なくとも1つの非水素置換基を有する基を意味する。本明細書において使用する場合、別段の指示がない限り以下の定義が適用される。「置換されているまたは非置換の」という用語は、「場合により置換されている」という句、または「(非)置換」という用語と交換可能に使用される。別段の指示がない限り、場合により置換されている基は、基の置換可能な位置それぞれに置換基を有していてもよく、各置換は他の置換から独立している。

【0032】

20

Q^1 または Q^2 が4または7員複素環式環系である場合、他様の記載がない限り、任意の利用可能な炭素または窒素環原子を介して式1の残部に結合していてもよい。上記のように、 Q^1 および Q^2 は、(とりわけ) 本発明の概要において定義した置換基の群から選択される1つまたはそれ以上の置換基で場合により置換されているフェニルとすることができる。1~5個の置換基で場合により置換されているフェニルの例は、提示1にU-1として図示する環であり、ここで、例えば、 R^v は、本発明の概要において Q^1 について定義したように R^{10} であり、または R^v は、本発明の概要において Q^2 について定義したように R^{11} であり、 r は整数(0~5)である。

【0033】

30

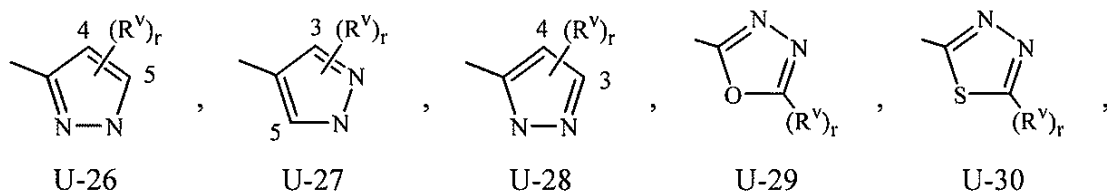
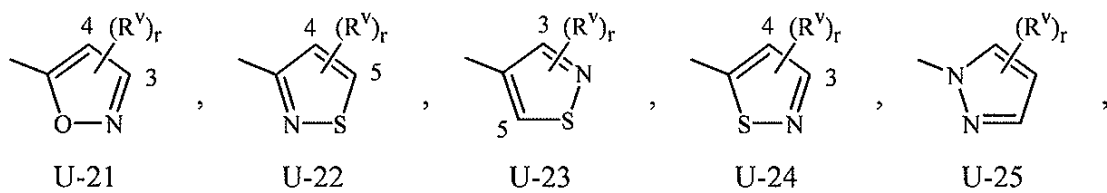
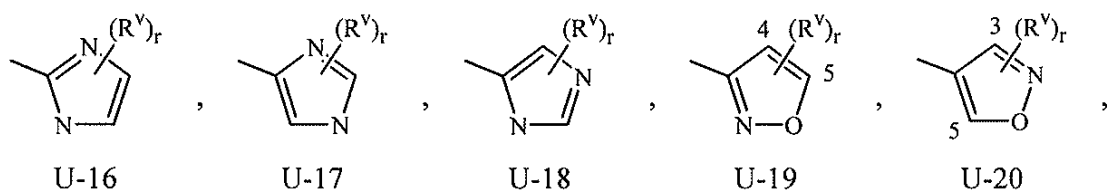
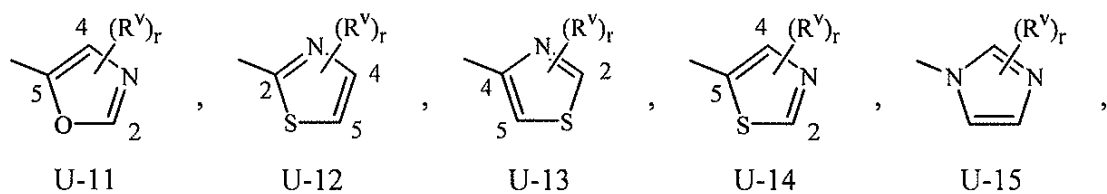
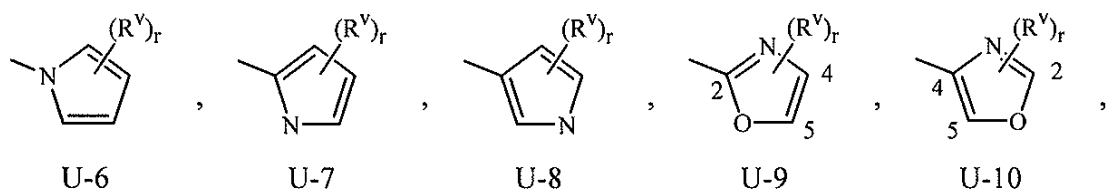
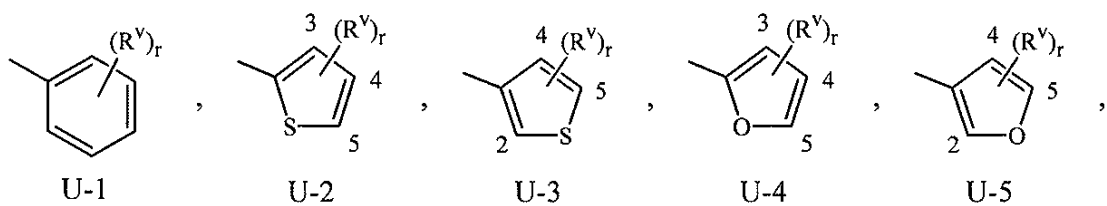
上記のように、 Q^1 および Q^2 は、(とりわけ) 本発明の概要において定義した置換基の群から選択される1つまたはそれ以上の置換基で置換されているまたは非置換の、5または6員不飽和複素環式環とすることができる。1つまたはそれ以上の置換基で置換されているまたは非置換の、5または6員不飽和芳香族複素環式環の例としては、提示1に図示する環U-2~U-61が挙げられ、ここで、 R^v は、 Q^1 または Q^2 について本発明の概要において定義した任意の置換基であり、 r は0~4の整数であって、各U基上の利用可能な位置の数によって限定される。U-29、U-30、U-36、U-37、U-38、U-39、U-40、U-41、U-42およびU-43は利用可能な位置が1つしかないため、これらのU基については r は0または1の整数に限定され、 r が0であるということは、U基が非置換であって、 $(R^v)_r$ で示される位置に水素が存在することを意味する。

【0034】

40

【化 3】

提示 1



10

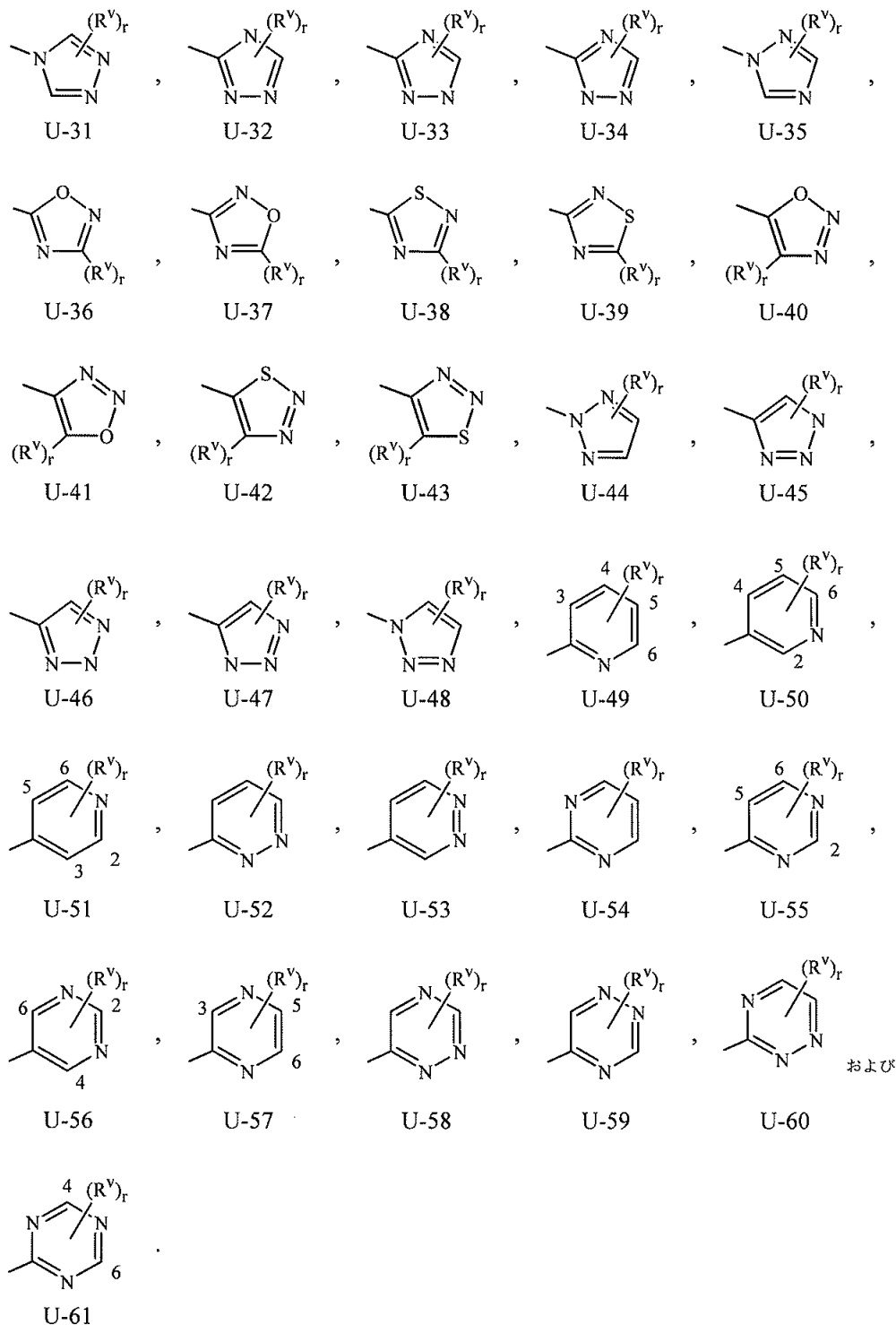
20

30

40

50

【化 4】



10

20

30

40

【 0 0 3 5 】

Q¹またはQ²が、発明の概要においてQ¹またはQ²について定義した置換基の群から選択される1つまたはそれ以上の置換基で場合により置換されている5または6員の飽和または不飽和非芳香族複素環式環である場合、複素環の1つまたは2つの炭素環員は、場合によりカルボニル部分の酸化形態であり得ることに留意されたい。

【 0 0 3 6 】

2個以下のO原子および2個以下のS原子から選択される環員を含有し、5個以下の炭素原子環員上で発明の概要において定義した置換基で場合により置換されている5または6員の飽和または非芳香族不飽和複素環式環の例としては、提示2に図示する環G - 1 ~

50

G - 3 5 が挙げられる。G 基上の結合点が浮遊しているものとして図示されている場合、G 基は、G 基の任意の利用可能な炭素または窒素を介し、水素原子の置換によって式 1 の残部に結合可能であることに留意されたい。R^v に対応する任意選択の置換基は、水素原子の置換によって任意の利用可能な炭素または窒素に結合可能である。これらの G 環の場合、r は典型的には 0 ~ 4 の整数であり、各 G 基上の利用可能な位置の数によって限定される。

【 0 0 3 7 】

Q¹ または Q² が G - 2 8 ~ G - 3 5 から選択される環を含む場合、G² は、O、S または N から選択されることに留意されたい。G² が N である場合、窒素原子は、H または発明の概要において Q¹ または Q² について定義した R^v に対応する置換基（即ち、炭素原子上の R^{1 0} または R^{1 1} および窒素原子上の R^{1 2} または R^{1 3}）のいずれかでの置換によってその原子価を満たすことができることに留意されたい。

【 0 0 3 8 】

10

20

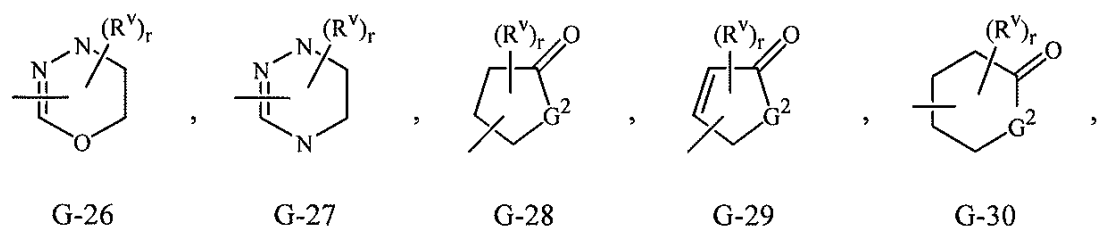
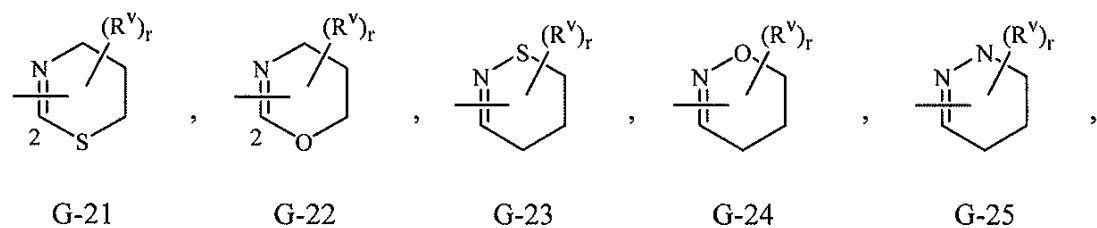
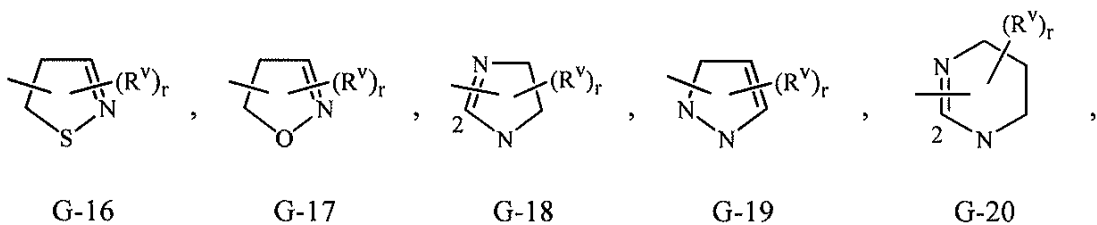
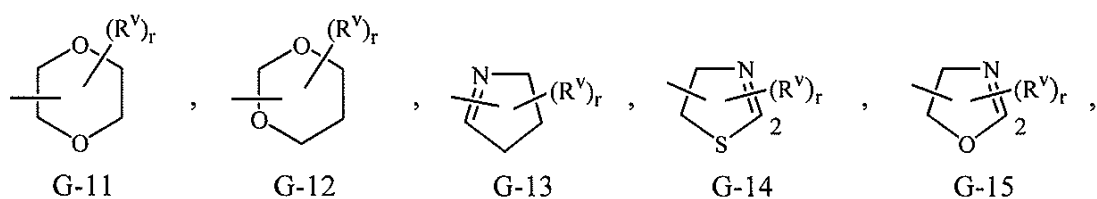
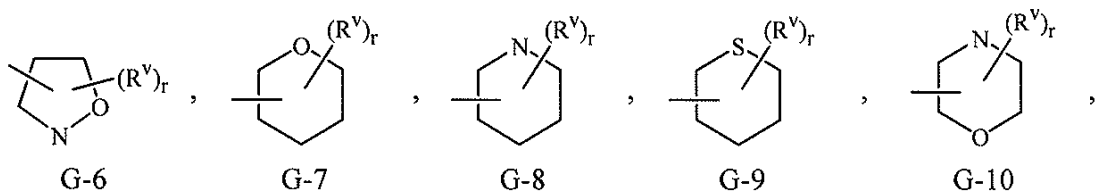
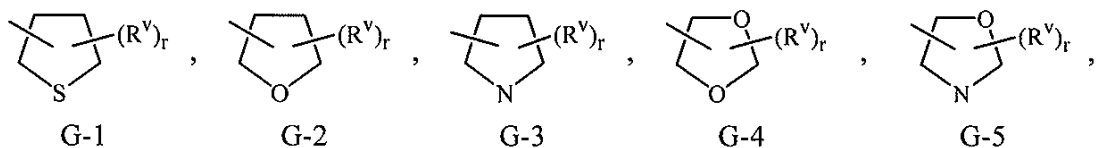
30

40

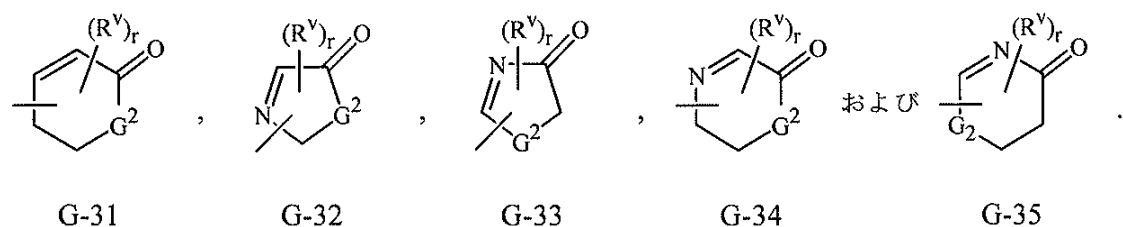
50

【化 5】

提示 2



【化 6】



10

20

30

40

50

【 0 0 3 9 】

上記のように、 Q^1 または Q^2 は、（とりわけ）発明の概要において定義した置換基の群（即ち、炭素原子上の R^{10} または R^{11} および窒素原子上の R^{12} または R^{13} ）から選択される1つまたはそれ以上の置換基で場合により置換されている8、9または10員の縮合二環式環系とすることができる。1つまたはそれ以上の置換基で場合により置換されている8、9または10員の縮合二環式環系の例としては、提示3に図示するような環U-81～U-123が挙げられ、ここで、 R^v は、発明の概要において Q^1 または Q^2 について定義した任意の置換基（即ち、炭素原子上の R^{10} または R^{11} および窒素原子上の R^{12} または R^{13} ）であり、 r は、典型的には0～5の整数である。

【 0 0 4 0 】

10

20

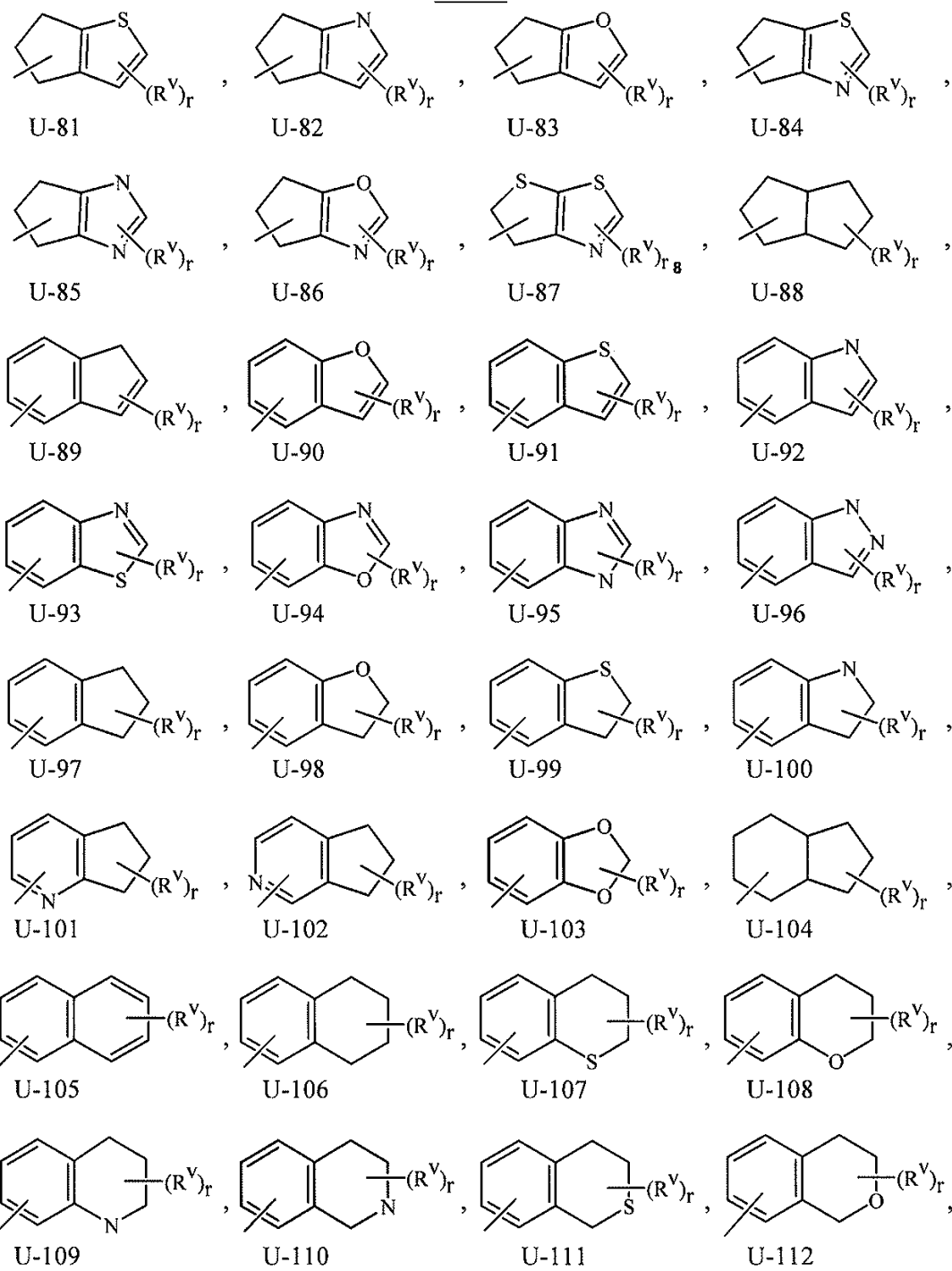
30

40

50

【化 7】

提示 3



10

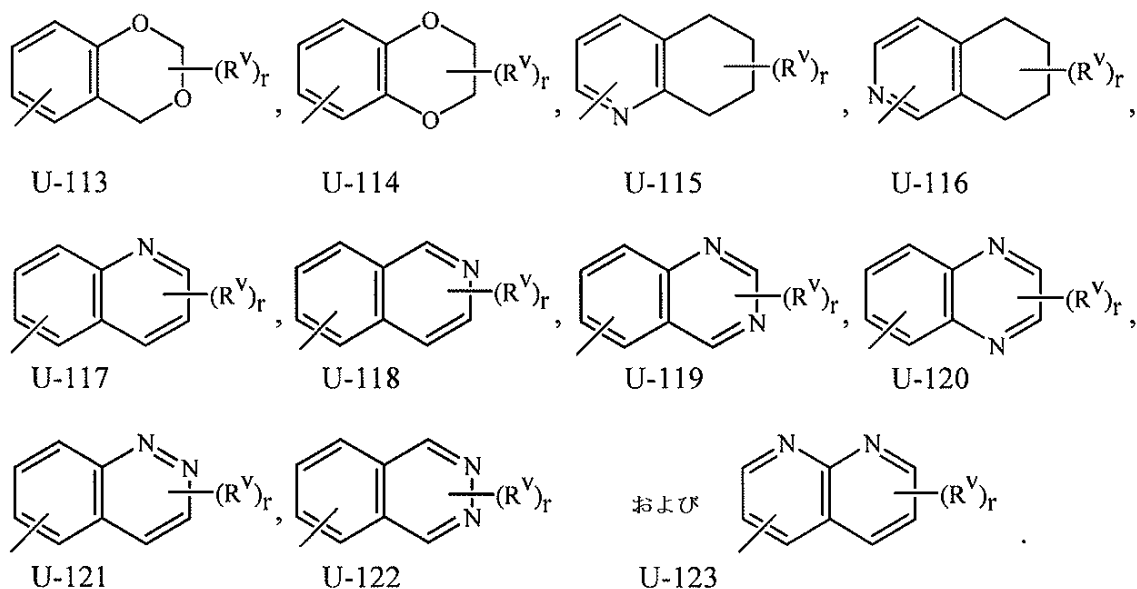
20

30

40

50

【化 8】



10

【 0 0 4 1】

20

構造 U - 1 ~ U - 1 2 3 に R^V 基が示されているが、これらは任意選択の置換基であるため、存在する必要はないことに留意されたい。R^V が H であり原子に結合している場合、前記原子は非置換であるのと同じであることに留意されたい。置換して原子価を満たす必要のある窒素原子は、H または R^V で置換される。(R^V)_r と U 基との間の結合点が浮遊しているものとして図示されている場合、(R^V)_r は、U 基の任意の利用可能な炭素原子または窒素原子に結合可能であることに留意されたい。U 基上の結合点が浮遊しているものとして図示されている場合、U 基は、U 基の任意の利用可能な炭素または窒素を介し、水素原子の置換によって式 1 の残部に結合可能であることに留意されたい。U 基によっては、4 つ未満の R^V 基（例えば、U - 2 ~ U - 5、U - 7 ~ U - 4 8、および U - 5 2 ~ U - 6 1）でのみで置換できることに留意されたい。

30

【 0 0 4 2】

芳香族および非芳香族の複素環式環および環系の製造を可能にする多種多様な合成方法が、当技術分野で公知である；包括的概説については、全 8 巻の *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*、A. R. Katritzky および C. W. Rees 監修、Pergamon Press、Oxford、1984、および全 12 巻の *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*、A. R. Katritzky、C. W. Rees および E. F. V. Scriven 監修、Pergamon Press、Oxford、1996 を参照されたい。

【 0 0 4 3】

本発明の化合物は、1 つまたはそれ以上の立体異性体として存在することができる。様々な立体異性体は、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロプ異性体および幾何異性体を含む。立体異性体は、構成が同一であるが、空間における原子の配置が異なる異性体であり、エナンチオマー、ジアステレオマー、シス-トランス異性体（幾何異性体としても公知である）およびアトロプ異性体を含む。アトロプ異性体は、異性体種の単離が可能であるほど回転障壁が十分に大きい単結合周りの束縛回転によって生じる。当業者であれば理解することであるが、1 種の立体異性体が他の立体異性体（複数可）と比して豊富化された場合、または他の立体異性体（複数可）から分離された場合、活性が高まる、および/または有益な効果を発揮することがある。更に、当業者には、前記立体異性体を分離、豊富化、および/または選択的に製造する方法は公知である。本発明の化合物は、立体異性体の混合物、個別の立体異性体、または光学的に活性な形態として存在してもよい。

40

50

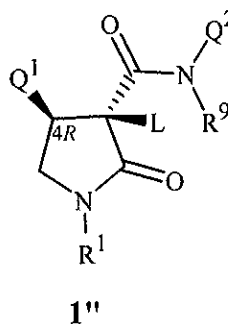
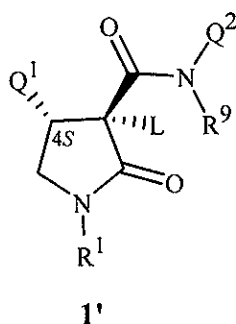
特に、 R^4 および R^5 がそれぞれ H である場合、 $C(O)N(Q^2)(R^9)$ および Q^1 置換基は、典型的にはピロリジノン環上で主に熱力学的に好適なトランス配置にある。

【0044】

例えば、以下に示すように、環の3位の炭素に結合した $C(O)N(Q^2)(R^9)$ 部分（即ち、 Y^1 と Y^2 の両方が O であり、 R^1 が H であり、J が $-CR^2R^3-$ であり、 R^2 および R^3 が両方とも H である式1の化合物）および環の4位の炭素に結合した Q^1 は一般に、トランス配置で見いだされる。これらの2個の炭素原子は両方ともキラル中心を有する。最もよく見られるエナンチオマー対が式1' および式1'' として示されている。本発明は、全ての立体異性体に関するが、生物学的な実施可能性の点から好適なエナンチオマーは、式1' であるとされる。立体異性の態様全てに関する包括的考察については、Ernest L. Eliel および Samuel H. Wilen、Stereochemistry of Organic Compounds、John Wiley & Sons、1994を参照されたい。

【0045】

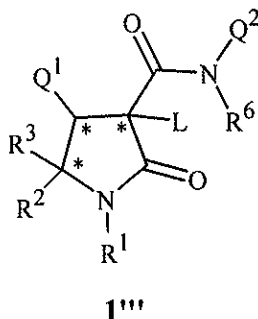
【化9】



【0046】

更に、当業者であれば理解することであるが、ピロリジノン環の5位の炭素原子（即ち、J が $-CR^2R^3-$ である場合、 R^2 と R^3 の両方が結合している炭素原子）も、式1''', に示すように（*）で表される立体中心を含有する。本発明は、全ての立体異性体に関し、したがって、 R^2 または R^3 のいずれかが同じ置換基以外である場合、ジアステレオマーの混合物も可能である。

【化10】



【0047】

本明細書に描かれる分子の描写は、立体化学を描写するための標準的な慣例に従う。立体配置を示すために、図の平面から上方向に観察者に向かう結合は実線のくさびで示され、くさびの幅広端が、図の平面から観察者に向かって上方向にある原子に結合している。図の平面の下方向に観察者から離れた方向に向かう結合は破線のくさびで示され、くさびの幅狭端が、観察者により近い原子に結合している。一定幅の線は、実線または破線のくさびで示される結合に対して反対または中立の方向の結合を示し；一定幅の線は更に、特

定の立体配置が指定されることを意図しない分子または分子の一部における結合を表す。

【 0 0 4 8 】

本発明は更に、ラセミ混合物、例えば、式 1' および 1'' (および場合により 1''') のエナンチオマーを等量含む。加えて、本発明は、ラセミ混合物に比べて式 1 のエナンチオマーが豊富化された化合物を含む。更に、式 1 の化合物の本質的に純粋なエナンチオマー、例えば、式 1' および式 1'' が含まれる。

【 0 0 4 9 】

エナンチオマー豊富化をした場合、一方のエナンチオマーは他方よりも多く存在し、豊富化の程度は、 $(2x - 1) \cdot 100\%$ で定義されるエナンチオマー過剰率 (「e e」) という表現によって定義することができ、ここで、x は混合物中の主要なエナンチオマーのモル分率である (例えば、20% の e e は、エナンチオマーの比 60 : 40 に相当する)。

10

【 0 0 5 0 】

好ましくは、本発明の組成物は、より活性な異性体のエナンチオマー過剰率が少なくとも 50% ; より好ましくはエナンチオマー過剰率が少なくとも 75% ; 更により好ましくはエナンチオマー過剰率が少なくとも 90% ; 最も好ましくはエナンチオマー過剰率が少なくとも 94% である。特に注目すべきは、より活性な異性体のエナンチオマー的に純粋な実施形態である。

【 0 0 5 1 】

式 1 の化合物は、追加のキラル中心を含むことができる。例えば、 R^A (即ち、L - 1 上の置換基としての) および L - 2 ~ L - 4 のような置換基および他の分子構成成分は、それ自体がキラル中心を含有していてもよい。本発明は、ラセミ混合物だけでなく、こうした追加のキラル中心において豊富化された本質的に純粋な立体配置も含む。

20

【 0 0 5 2 】

本発明の化合物は、式 1 におけるアミド結合 (例えば、 $C(O)N(Q^2)(R^9)$) 周りの束縛回転に起因する 1 種またはそれ以上の配座異性体として存在することができる。本発明は、配座異性体の混合物を含む。加えて、本発明は、1 つの配座異性体が他の異性体に対して豊富化されている化合物を含む。

【 0 0 5 3 】

エナンチオマー豊富化をした場合、一方のエナンチオマーは他方よりも多く存在し、豊富化の程度は、キラル高速液体クロマトグラフィーによって判定される 2 種のエナンチオマーの相対面積% として表されるエナンチオマー比 (E R) という表現によって定義することができる。

30

【 0 0 5 4 】

好ましくは、本発明の組成物は、より活性な異性体の E R が少なくとも 50% ; より好ましくは E R が少なくとも 75% ; 更により好ましくは E R が少なくとも 90% ; 最も好ましくは E R が少なくとも 94% である。特に注目すべきは、より活性な異性体のエナンチオマー的に純粋な実施形態である。

【 0 0 5 5 】

式 1 の化合物は、追加のキラル中心を含むことができる。例えば、 R^2 、 R^3 および R^6 のような置換基および他の分子構成成分は、それ自体がキラル中心を含有していてもよい。本発明は、ラセミ混合物だけでなく、こうした追加のキラル中心において豊富化された本質的に純粋な立体配置も含む。

40

【 0 0 5 6 】

式 1 の化合物は、典型的には 2 種以上の形態で存在し、したがって、式 1 は、それが表す化合物の結晶形態および非結晶形態全てを含む。非結晶形態は、ワックスおよびゴムのような固体である実施形態、ならびに溶液および熔融物のような液体である実施形態を含む。結晶形態は、本質的に単結晶型を表す実施形態、および、多形体 (即ち、異なる結晶型) の混合物を表す実施形態を含む。「多形体」という用語は、異なる結晶形態で結晶化が可能である化合物の特定の結晶形態を指し、これらの形態は、結晶格子中に分子の異な

50

る配置および／または配座を有する。多形体は同一の化学組成を有する場合があるが、これらは、格子中に弱くまたは強く結合可能な共結晶化水または他の分子の存在または不在により、組成が異なっている場合もある。多形体は、結晶形状、密度、硬度、色、化学的安定性、融点、吸湿性、懸濁性、溶解速度および生物学的利用可能性のような化学的、物理的および生物学的性質が異なっている場合がある。当業者であれば理解することであるが、式1の化合物の多形体は、式1の同一の化合物の他の多形体または多形体の混合物に比して、有益な効果（例えば、有用な製剤の製造に対する適合性、生物学的性能の向上）を示す可能性がある。式1の化合物の特定の多形体の製造および単離は、例えば、選択した溶媒および温度を用いる結晶化を含む、当業者に公知の方法により達成可能である。多形体性に係る包括的な考察については、R. Hilfiker, Ed., *polymorphism in the Pharmaceutical Industry*, Wiley-VCH, Weinheim, 2006を参照されたい。

10

【0057】

当業者であれば理解することであるが、窒素は、酸化物への酸化のためには利用可能な孤立電子対を必要とするため、全ての窒素含有複素環がN-オキシドを形成可能ではない；当業者であれば、N-オキシドを形成可能な窒素含有複素環を認識する。更に、当業者であれば理解することであるが、第三級アミンはN-オキシドを形成可能である。複素環および第三級アミンのN-オキシド製造のための合成方法は当業者に周知であり、過酢酸およびm-クロロ過安息香酸(MCPBA)のようなペルオキシ酸、過酸化水素、t-ブチルヒドロペルオキシドのようなアルキルヒドロペルオキシド、過ホウ酸ナトリウム、ならびにジメチルジオキシランのようなジオキシランによる複素環および第三級アミンの酸化が含まれる。N-オキシドの製造のためのこれらの方法は、文献において広範に記載および概説されており、例えば：T. L. Gilchristの*Comprehensive Organic Synthesis*、第7巻、748～750頁、S. V. Ley編、Pergamon Press；M. TislerおよびB. Stanovnikの*Comprehensive Heterocyclic Chemistry*、第3巻、18～20頁、A. J. BoultonおよびA. McKillop編、Pergamon Press；M. R. GrimmettおよびB. R. T. Keeneの*Advances in Heterocyclic Chemistry*、第43巻、149～161頁、A. R. Katritzky編、Academic Press；M. TislerおよびB. Stanovnikの*Advances in Heterocyclic Chemistry*、第9巻、285～291頁、A. R. KatritzkyおよびA. J. Boulton編、Academic Press；ならびにG. W. H. CheesemanおよびE. S. G. Werstiukの*Advances in Heterocyclic Chemistry*、第22巻、390～392頁、A. R. KatritzkyおよびA. J. Boulton編、Academic Pressを参照されたい。

20

30

【0058】

当業者であれば認識することであるが、環境中、および生理学的条件下では、化合物の塩はその対応する非塩形態と平衡状態にあるので、塩が非塩形態の生物学的有用性を共有する。したがって、式1の化合物の多種多様な塩が、望ましくない植生の防除に有用である（即ち、農学的に適切である）。式1の化合物の塩としては、臭化水素酸、塩酸、硝酸、リン酸、硫酸、酢酸、酪酸、フマル酸、乳酸、マレイン酸、マロン酸、シュウ酸、プロピオン酸、サリチル酸、酒石酸、4-トルエンスルホン酸または吉草酸のような無機酸または有機酸との酸付加塩が挙げられる。式1の化合物がカルボン酸またはフェノールのような酸性部分を含有する場合、塩には、ピリジン、トリエチルアミンもしくはアンモニアのような有機塩基もしくは無機塩基と共に形成された塩、またはナトリウム、カリウム、リチウム、カルシウム、マグネシウムもしくはバリウムのアミド、水素化物、水酸化物または炭酸塩も含まれる。したがって、本発明は、式1から選択される化合物、その立体異性体、N-オキシドおよび農業的に適切な塩を含む。

40

50

【 0 0 5 9 】

本発明の概要に記載の本発明の実施形態は以下を含む（ここで、以下の実施形態において用いられる式 1 はその N - オキシドおよび塩を含む）：

【 0 0 6 0 】

実施形態 1 . 発明の概要に記載の通りである、その全ての立体異性体、N - オキシド、および塩を含む式 1 の化合物、それらを含む農業用組成物、ならびにそれらの除草剤としての使用。

【 0 0 6 1 】

実施形態 2 . L は、L - 1、L - 2 または L - 3 から選択される、実施形態 1 の化合物。

【 0 0 6 2 】

実施形態 3 . L は、L - 1 または L - 2 から選択される、実施形態 2 の化合物。

【 0 0 6 3 】

実施形態 4 . L は、L - 1 である、実施形態 3 の化合物。

【 0 0 6 4 】

実施形態 5 . L は、L - 2 である、実施形態 4 の化合物。

【 0 0 6 5 】

実施形態 6 . R^A は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_7$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルコキシもしくは $C_3 \sim C_9$ シクロアルコキシであり、それぞれ、 R^8 もしくは G^1 から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または

R^A は、 G^1 である、実施形態 1 ~ 5 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 0 6 6 】

実施形態 7 . R^A は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_7$ アルコキシもしくは $C_1 \sim C_7$ ハロアルコキシであり、それぞれ、 R^8 から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または

R^A は、 G^1 である、実施形態 6 の化合物。

【 0 0 6 7 】

実施形態 8 . R^A は、 $C_1 \sim C_7$ アルキルまたは $C_1 \sim C_7$ アルコキシであり、それぞれ、 R^8 から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換または非置換である、実施形態 7 の化合物。

【 0 0 6 8 】

実施形態 9 . R^A は、 $C_1 \sim C_3$ アルキルであり、 R^8 から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換または非置換である、実施形態 8 の化合物。

【 0 0 6 9 】

実施形態 10 . R^A は、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシであり、 R^8 から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換または非置換である、実施形態 8 の化合物。

【 0 0 7 0 】

実施形態 11 . R^B は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルである、実施形態 1 ~ 4 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 0 7 1 】

実施形態 12 . R^B は、H、 $-OCH_3$ 、 CF_3 または CH_3 である、実施形態 11 の化合物。

【 0 0 7 2 】

実施形態 13 . R^B は、H、 $-OCH_3$ または CH_3 である、実施形態 12 の化合物。

【 0 0 7 3 】

実施形態 14 . R^B は、H である、実施形態 13 の化合物。

【 0 0 7 4 】

実施形態 15 . R^C は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルである、実施形態 1 ~ 4 または 11 ~ 15 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 0 7 5 】

10

20

30

40

50

実施形態 16 . R^C は、H、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである、実施形態 15 の化合物。

【0076】

実施形態 17 . R^C は、H または CH_3 である、実施形態 16 の化合物。

【0077】

実施形態 18 . R^C は、H である、実施形態 17 の化合物。

【0078】

実施形態 19 . R^D は、H、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニルである、実施形態 18 の化合物。

【0079】

実施形態 20 . R^D は、H、 CH_3 、 CH_2CH_3 または $-C(=O)CH_3$ である、実施形態 19 の化合物。

【0080】

実施形態 21 . R^D は、H である、実施形態 20 の化合物。

【0081】

実施形態 22 . R^D は、 CH_3 または CH_2CH_3 である、実施形態 20 の化合物。

【0082】

実施形態 23 . R^D は、 $-C(=O)CH_3$ である、実施形態 20 の化合物。

【0083】

実施形態 24 . R^E は、H、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、ホルミル、 $-C(O)NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニルまたは $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニルである、実施形態 1 ~ 4 または 11 ~ 23 のいずれか 1 つの化合物。

【0084】

実施形態 25 . R^E は、H、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、ホルミル、 $-C(O)NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニルまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルである、実施形態 24 の化合物。

【0085】

実施形態 26 . R^E は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニルまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルである、実施形態 25 の化合物。

【0086】

実施形態 27 . R^E は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルである、実施形態 26 の化合物。

【0087】

10

20

30

40

50

実施形態 28 . R^E は、H、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニルである、実施形態 27 の化合物。

【0088】

実施形態 29 . R^F は、ホルミル、 $-C(O)NH_2$ 、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニル、 $-P(=O)(OH)_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルホスホリル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルホスホリル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルホスホリル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルコキシホスホリル、 $C_6 \sim C_{14}$ ジシクロアルコキシホスホリル、 $C_8 \sim C_{16}$ ジシクロアルキルアルコキシホスホリル、 $C_2 \sim C_{12}$ ビス(アルキルアミノ)ホスホリル、 $C_4 \sim C_{24}$ ビス(ジアルキルアミノ)ホスホリル；または R^{16} で置換されているまたは非置換のフェニルである、実施形態 1、2 または 11 ~ 18 のいずれか 1 つの化合物。

【0089】

実施形態 30 . R^F は、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニルもしくは $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル；または R^{16} で置換されているまたは非置換のフェニルである、実施形態 29 の化合物。

【0090】

実施形態 31 . R^F は、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルである、実施形態 30 の化合物。

【0091】

実施形態 32 . R^F は、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニルである、実施形態 31 の化合物。

【0092】

実施形態 33 . R^G は、ホルミル、 $-C(O)NH_2$ 、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニルまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニルである、実施形態 1 ~ 3 または 11 ~ 18 のいずれか 1 つの化合物。

【0093】

実施形態 34 . R^G は、ホルミル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニルまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニルである、実施形態 33 の化合物。

【0094】

10

20

30

40

50

実施形態 35 . R^G は、ホルミル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニルまたは $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニルである、実施形態 34 の化合物。

【0095】

実施形態 36 . R^G は、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニルである、実施形態 35 の化合物。

【0096】

実施形態 37 . R^G は、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニルである、実施形態 36 の化合物。

【0097】

実施形態 38 . 各 R^8 は、独立してシアノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシまたは $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシである、実施形態 1 ~ 11 のいずれか 1 つの化合物。

【0098】

実施形態 39 . 各 R^8 は、独立して $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシである、実施形態 38 の化合物。

【0099】

実施形態 40 . 各 R^8 は、独立して $C_1 \sim C_6$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシである、実施形態 39 の化合物。

【0100】

実施形態 40A . 各 R^8 は、独立して $C_1 \sim C_6$ アルコキシである、実施形態 40 の化合物。

【0101】

実施形態 41 . J は、 $-CR^2R^3-$ 、 $-CR^2R^3-CR^4R^5-$ または $-NR^6-$ である、実施形態 1 ~ 40A のいずれか 1 つの化合物。

【0102】

実施形態 42 . J は、 $-CR^2R^3-$ または $-CR^2R^3-CR^4R^5-$ である、実施形態 41 の化合物。

【0103】

実施形態 43 . J は、 $-CR^2R^3-CR^4R^5-$ である、実施形態 42 の化合物。

【0104】

実施形態 44 . J は、 $-CR^2R^3-$ である、実施形態 43 の化合物。

【0105】

実施形態 45 . Y^1 および Y^2 は、それぞれ独立して O または S である、実施形態 1 ~ 44 のいずれか 1 つの化合物。

【0106】

実施形態 46 . Y^1 および Y^2 は、それぞれ独立して S である、実施形態 45 の化合物。

【0107】

実施形態 47 . Y^1 および Y^2 は、それぞれ独立して O である、実施形態 46 の化合物。

【0108】

実施形態 48 . R^1 は、H、 CHO 、 $C_3 \sim C_8$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_1 \sim C_6$ 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、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim$

10

20

30

40

50

C₈アルコキシカルボニル、C₂～C₈ハロアルコキシカルボニル、C₂～C₈アルキルアミノカルボニル、C₃～C₁₀ジアルキルアミノカルボニルまたはC₄～C₁₀シクロアルキルアミノカルボニルである、実施形態1～47のいずれか1つの化合物。

【0109】

実施形態49．R¹は、H、C₃～C₈アルキルカルボニルアルキル、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆シアノアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₄～C₈シクロアルキルアルキル、C₂～C₈アルコキシアルキル、C₂～C₈ハロアルコキシアルキル、C₂～C₈アルキルカルボニル、C₂～C₈ハロアルキルカルボニル、C₄～C₁₀シクロアルキルカルボニル、C₂～C₈アルコキシカルボニルまたはC₂～C₈ハロアルコキシカルボニルである、実施形態48の化合物。

10

【0110】

実施形態50．R¹は、H、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆シアノアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₄～C₈シクロアルキルアルキル、C₂～C₈アルコキシアルキル、C₂～C₈ハロアルコキシアルキルまたはC₂～C₈アルコキシカルボニルである、実施形態49の化合物。

【0111】

実施形態51．R¹は、H、C₁～C₆アルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₄～C₈シクロアルキルアルキルまたはC₂～C₈アルコキシアルキルである、実施形態50の化合物。

【0112】

実施形態52．R¹は、H、CH₃、CH₂CH₃、シクロプロピル、シクロプロピルメチルまたはCH₂OCH₃である、実施形態51の化合物。

20

【0113】

実施形態53．Q¹は、フェニル環もしくはナフタレニル環系であり、各環もしくは環系は、R¹⁰から独立して選択される5個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または、5～6員複素環式環；もしくは8～10員二環式環系であり、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに2個以下のO原子、2個以下のS原子および4個以下のN原子から独立して選択される1～4個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2個以下の炭素環員はC(=O)およびC(=S)から独立して選択され、硫黄原子環員はS(=O)_u(=NR¹⁴)_vから独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上でR¹⁰から独立して選択されるおよび窒素原子環員上でR¹²から独立して選択される4個以下の置換基で置換または非置換である、実施形態1～52のいずれか1つの化合物。

30

【0114】

実施形態54．Q¹は、R¹⁰から独立して選択される4個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；または、5～6員複素環式環であり、各環は、炭素原子、ならびに2個以下のO原子、2個以下のS原子および4個以下のN原子から独立して選択される1～4個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、各環は、炭素原子環員上でR¹⁰から独立して選択されるおよび窒素原子環員上でR¹²から独立して選択される4個以下の置換基で置換または非置換である、実施形態53の化合物。

40

【0115】

実施形態55．Q¹は、R¹⁰から独立して選択される4個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環である、実施形態54の化合物。

【0116】

実施形態56．Q¹は、R¹⁰から独立して選択される3個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環である、実施形態55の化合物。

【0117】

実施形態57．Q¹は、R¹⁰から独立して選択される2個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環である、実施形態56の化合物。

【0118】

50

実施形態 58 . Q^1 は、 R^{10} から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換されたフェニル環である、実施形態 57 の化合物。

【0119】

実施形態 59 . Q^1 は、 R^{10} から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換されたフェニル環であり、ここで、1 個の置換基はパラ (4) 位置にある、実施形態 58 の化合物。

【0120】

実施形態 60 . Q^1 は、 R^{10} から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換された α フェニル環であり、ここで、1 個の置換基はメタ (3) 位置にある、実施形態 59 の化合物。

【0121】

実施形態 61 . Q^1 は、非置換のフェニル環以外である、実施形態 1 ~ 60 のいずれか 1 つの化合物。

【0122】

実施形態 62 . Q^1 は、炭素原子および 2 個以下の O 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有する 8 ~ 10 員二環式環系であり、各環系は、炭素原子環員上で R^{10} から独立して選択される 4 個以下の置換基で場合により置換されている、実施形態 61 の化合物。

【0123】

実施形態 63 . Q^1 は、炭素原子および 2 個以下の O 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有する 9 員二環式環系であり、各環系は、炭素原子環員上で R^{10} から独立して選択される 4 個以下の置換基で場合により置換されている、実施形態 62 の化合物。

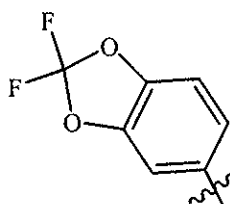
【0124】

実施形態 64 . Q^1 は、炭素原子および 2 個の O 原子から選択される環員を含有する 9 員複素芳香族二環式環系であり、系は、炭素原子環員上で R^{10} から独立して選択される 3 個以下の置換基で場合により置換されている (即ち、提示 3 の U - 103)、実施形態 63 の化合物。

【0125】

実施形態 65 . Q^1 は、U - 103A :

【化 11】



U-103A.

である、実施形態 64 の化合物。

【0126】

実施形態 66 . Q^2 は、フェニル環であり、各環は、 R^{11} から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または、5 ~ 6 員複素環式環；もしくは 8 ~ 10 員二環式環系であり、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに 2 個以下の O 原子、2 個以下の S 原子および 4 個以下の N 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2 個以下の炭素環員は $C(=O)$ および $C(=S)$ から独立して選択され、硫黄原子環員は $S(=O)_u(=NR^{14})_v$ から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で R^{11} から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で R^{13} から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換または非置換である、実施形態 1 ~ 65 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 1 2 7 】

実施形態 6 7 . Q^2 は、 R^{11} から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；または、5 ~ 6 員複素環式環；もしくは 8 ~ 10 員二環式環系であり、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに 2 個以下の O 原子、2 個以下の S 原子および 4 個以下の N 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2 個以下の炭素環員は $C(=O)$ および $C(=S)$ から独立して選択され、硫黄原子環員は $S(=O)_u(=NR^{14})_v$ から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で R^{11} から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で R^{13} から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換または非置換である、実施形態 6 6 の化合物。

10

【 0 1 2 8 】

実施形態 6 8 . Q^2 は、 R^{11} から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；または、炭素原子および 4 個以下の N 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有する 5 ~ 6 員複素環式環であり、ここで、2 個以下の炭素環員は $C(=O)$ および $C(=S)$ から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で R^{11} から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で R^{13} から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換または非置換である、実施形態 6 7 の化合物。

【 0 1 2 9 】

実施形態 6 9 . Q^2 は、 R^{11} から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環である、実施形態 6 8 の化合物。

20

【 0 1 3 0 】

実施形態 7 0 . Q^2 は、 R^{11} から独立して選択される 3 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環である、実施形態 6 9 の化合物。

【 0 1 3 1 】

実施形態 7 1 . Q^2 は、 R^{11} から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環である、実施形態 7 0 の化合物。

【 0 1 3 2 】

実施形態 7 2 . Q^2 は、 R^{11} から独立して選択される少なくとも 2 個の置換基で置換されたフェニル環であり、ここで、1 個の置換基はオルト (2) 位置にある、実施形態 7 1 の化合物。

30

【 0 1 3 3 】

実施形態 7 3 . Q^2 は、 R^{11} から独立して選択される少なくとも 2 個の置換基で置換されたフェニル環であり、ここで、1 個の置換基はメタ (3) 位置にある、実施形態 7 2 の化合物。

【 0 1 3 4 】

実施形態 7 4 . Q^2 は、非置換のフェニル環以外である、実施形態 1 ~ 7 3 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 1 3 5 】

実施形態 7 5 . R^2 および R^3 は、それぞれ独立して H または $C_1 \sim C_4$ アルキルである、実施形態 1 ~ 7 4 のいずれか 1 つの化合物。

40

【 0 1 3 6 】

実施形態 7 6 . R^2 および R^3 は、それぞれ独立して H または CH_3 である、実施形態 7 5 の化合物。

【 0 1 3 7 】

実施形態 7 7 . R^2 および R^3 は、それぞれ独立して H である、実施形態 7 6 の化合物。

【 0 1 3 8 】

実施形態 7 8 . R^4 および R^5 は、それぞれ独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ アルコキシである、実施形態 1 ~ 7 7 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 1 3 9 】

50

実施形態 79. R^4 および R^5 は、それぞれ独立して H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルである、実施形態 78 の化合物。

【0140】

実施形態 80. R^4 および R^5 は、それぞれ独立して H、 Cl または CH_3 である、実施形態 79 の化合物。

【0141】

実施形態 81. R^6 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ アルコキシである、実施形態 1 ~ 80 のいずれか 1 つの化合物。

【0142】

実施形態 82. R^6 は、H または $C_1 \sim C_6$ アルキルである、実施形態 81 の化合物。 10

【0143】

実施形態 83. R^6 は、H または CH_3 である、実施形態 82 の化合物。

【0144】

実施形態 84. R^6 は、H である、実施形態 83 の化合物。

【0145】

実施形態 85. R^1 および R^6 は、一緒になって C_3 アルキレンまたは $-CH_2OCH_2-$ となっている、実施形態 1 ~ 47 または 53 ~ 84 のいずれか 1 つの化合物。

【0146】

実施形態 86. R^1 および R^6 は、一緒になって C_3 アルキレンとなっている、実施形態 85 の化合物。 20

【0147】

実施形態 87. R^7 は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルである、実施形態 1 ~ 86 のいずれか 1 つの化合物。

【0148】

実施形態 88. R^7 は、H、F、 Cl または CH_3 である、実施形態 87 の化合物。

【0149】

実施形態 89. R^7 は、H または CH_3 である、実施形態 1 ~ 88 のいずれか 1 つの化合物。

【0150】

実施形態 90. R^7 は、H である、実施形態 89 の化合物。 30

【0151】

実施形態 91. R^9 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニルまたは $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニルである、実施形態 1 ~ 90 のいずれか 1 つの化合物。

【0152】

実施形態 92. R^9 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニルである、実施形態 91 の化合物。 40

【0153】

実施形態 93. R^9 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニルである、実施形態 92 の化合物。

【0154】

実施形態 94. R^9 は、H、 CH_3 または $-C(=O)CH_3$ である、実施形態 93 の化合物。

【0155】

実施形態 95. R^9 は、H である、実施形態 94 の化合物。

【0156】

実施形態 96. 各 R^{10} および R^{11} は、ハロゲン、ニトロ、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 C_1 50

$\sim C_8$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_8$ シアノアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ニトロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシハロアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_6 \sim C_{12}$ シクロアルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $-C(=O)OH$ 、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $-C(=O)NH_2$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ アルキルカルボニルアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニルオキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニルである、実施形態 1 ~ 9

10

20

【0157】

実施形態 97 . 各 R^{10} および R^{11} は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_6 \sim C_{12}$ シクロアルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ アルキルカルボニルアルコキシまたは $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニルオキシである、実施形態 96 の化合物。

30

【0158】

実施形態 98 . 各 R^{10} および R^{11} は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシまたは $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルコキシである、実施形態 97 の化合物。

40

【0159】

実施形態 99 . 各 R^{10} および R^{11} は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシである、実施形態 98 の化合物。

【0160】

実施形態 100 . 各 R^{10} および R^{11} は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシである、実施形態 99 の化合物。

50

【 0 1 6 1 】

実施形態 1 0 1 . 各 R^{10} および R^{11} は、独立してハロゲンまたは $C_1 \sim C_8$ アルキルである、実施形態 1 0 0 の化合物。

【 0 1 6 2 】

実施形態 1 0 2 . 各 R^{10} および R^{11} は、独立してハロゲンまたは $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルである、実施形態 1 0 0 の化合物。

【 0 1 6 3 】

実施形態 1 0 3 . 各 R^{10} および R^{11} は、独立してハロゲンまたは $C_1 \sim C_8$ アルコキシである、実施形態 1 0 0 の化合物。

【 0 1 6 4 】

実施形態 1 0 4 . 各 R^{10} および R^{11} は、独立してハロゲンまたは $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシである、実施形態 1 0 0 の化合物。

【 0 1 6 5 】

実施形態 1 0 5 . 各 R^{10} および R^{11} は、独立して $C_1 \sim C_8$ アルキルまたは $C_1 \sim C_8$ アルコキシである、実施形態 1 0 0 の化合物。

【 0 1 6 6 】

実施形態 1 0 6 . 各 R^{10} および R^{11} は、独立して $C_1 \sim C_8$ アルキルまたは $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルである、実施形態 1 0 0 の化合物。

【 0 1 6 7 】

実施形態 1 0 7 . 各 R^{12} および R^{13} は、独立して $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルコシアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_3$ アルキルアミノアルキルである、実施形態 1 ~ 1 0 6 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 1 6 8 】

実施形態 1 0 8 . 各 R^{12} および R^{13} は、独立して $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルまたは $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニルである、実施形態 1 0 7 の化合物。

【 0 1 6 9 】

実施形態 1 0 9 . 各 R^{12} および R^{13} は、独立して $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニルである、実施形態 1 0 8 の化合物。

【 0 1 7 0 】

実施形態 1 1 0 . 各 R^{12} および R^{13} は、独立して $C_1 \sim C_3$ アルキルである、実施形態 1 0 9 の化合物。

【 0 1 7 1 】

実施形態 1 1 1 . 各 R^{12} および R^{13} は、独立して CH_3 である、実施形態 1 1 0 の化合物。

【 0 1 7 2 】

実施形態 1 1 2 . 各 R^{14} は、独立して H または $-(C=O)CH_3$ である、実施形態 1 ~ 1 1 1 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 1 7 3 】

実施形態 1 1 3 . 各 R^{14} は、独立して H である、実施形態 1 1 2 の化合物。

【 0 1 7 4 】

実施形態 1 1 4 . R^{15} は、H、 CHO 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニルである、実施形態 1 ~ 1 1 3 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 1 7 5 】

実施形態 1 1 5 . R^{15} は、H、 CH_3 、 $-(C=O)CH_3$ または $-(C=O)CF_3$ である、実施形態 1 1 4 の化合物。

【 0 1 7 6 】

実施形態 1 1 6 . 各 R^{15} は、独立して H または CH_3 である、実施形態 1 1 5 の化合物。

10

20

30

40

50

【 0 1 7 7 】

実施形態 1 1 7 . 各 G^1 は、独立してフェニルであり；または、6 員複素環式環であり、それぞれ、 R^{17} から独立して選択される 4 個以下の置換基で環員上で置換または非置換である、実施形態 1 ~ 1 1 6 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 1 7 8 】

実施形態 1 1 8 . 各 G^1 は、独立してフェニルであり、 R^{17} から独立して選択される 3 個以下の置換基で環員上で置換または非置換である、実施形態 1 1 7 の化合物。

【 0 1 7 9 】

実施形態 1 1 9 . 各 R^{16} 、 R^{17} および R^{18} は、独立してハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ 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、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_8$ ヒドロキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルチオである、実施形態 1 ~ 1 1 8 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 1 8 0 】

実施形態 1 2 0 . 各 R^{16} 、 R^{17} および R^{18} は、独立してハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルである、実施形態 1 1 9 の化合物。

【 0 1 8 1 】

実施形態 1 2 1 . 各 R^{16} 、 R^{17} および R^{18} は、独立してハロゲン、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルである、実施形態 1 2 0 の化合物。

【 0 1 8 2 】

実施形態 1 2 2 . 各 R^{16} 、 R^{17} および R^{18} は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルである、実施形態 1 2 1 の化合物。

【 0 1 8 3 】

実施形態 1 2 3 . 各 R^{16} 、 R^{17} および R^{18} は、独立してハロゲンまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである、実施形態 1 2 2 の化合物。

【 0 1 8 4 】

実施形態 1 2 4 . 各 R^{16} 、 R^{17} および R^{18} は、独立してハロゲンである、実施形態 1 2 3 の化合物。

【 0 1 8 5 】

実施形態 1 2 5 . u と v の合計は 0 である、実施形態 1 ~ 1 2 4 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 1 8 6 】

実施形態 1 2 6 . u と v の合計は 2 である、実施形態 1 ~ 1 2 5 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 1 8 7 】

本発明の実施形態は、上記実施形態 1 ~ 1 2 6 だけでなく本明細書に記載する他の任意の実施形態も含め、どのように組み合わせることも可能であり、実施形態における可変要素についての説明は、式 1 の化合物だけでなく、式 1 の化合物の製造に有用な出発化合物および中間化合物にも関連する。加えて、本発明の実施形態は、上記実施形態 1 ~ 1 2 6 だけでなく本明細書に記載する他の任意の実施形態およびそれらの任意の組合せも含め、本発明の組成物および方法に関連する。

【 0 1 8 8 】

実施形態 A .

R^A は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_9$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_7$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルコキシもしくは $C_3 \sim C_9$ シクロアルコキシであり、それぞれ、 R^8 もしくは G^1 から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または

R^A は、 G^1 であり；

R^B は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^C は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^D は、H、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニルであり；

R^E は、H、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、ホルミル、 $-C(O)NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニルまたは $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニルであり；

R^F は、ホルミル、 $-C(O)NH_2$ 、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニル、 $-P(=O)(OH)_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ ジアルキルホスホリル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルホスホリル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルホスホリル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルコキシホスホリル、 $C_6 \sim C_{14}$ ジシクロアルコキシホスホリル、 $C_8 \sim C_{16}$ ジシクロアルキルアルコキシホスホリル、 $C_2 \sim C_{12}$ ビス(アルキルアミノ)ホスホリル、 $C_4 \sim C_{24}$ ビス(ジアルキルアミノ)ホスホリル；または R^{16} で置換されているまたは非置換のフェニルであり；

R^G は、ホルミル、 $-C(O)NH_2$ 、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニルまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニルであり；

Q^1 は、フェニル環もしくはナフタレニル環系であり、各環もしくは環系は、 R^{10} から独立して選択される 5 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または、5 ~ 6 員複素環式環；もしくは 8 ~ 10 員二環式環系であり、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに 2 個以下の O 原子、2 個以下の S 原子および 4 個以下の N 原子から独立して選

10

20

30

40

50

択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2 個以下の炭素環員は $C(=O)$ および $C(=S)$ から独立して選択され、硫黄原子環員は $S(=O)_u(=NR^{14})_v$ から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で R^{10} から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で R^{12} から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；

Q^2 は、フェニル環であり、各環は、 R^{11} から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または、5 ~ 6 員複素環式環；もしくは 8 ~ 10 員二環式環系であり、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに 2 個以下の O 原子、2 個以下の S 原子および 4 個以下の N 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2 個以下の炭素環員は $C(=O)$ および $C(=S)$ から独立して選択され、硫黄原子環員は $S(=O)_u(=NR^{14})_v$ から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で R^{11} から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で R^{13} から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；

J は、 $-CR^2R^3-$ 、 $-CR^2R^3-CR^4R^5-$ または $-NR^6-$ であり；

Y^1 および Y^2 は、それぞれ独立して O または S であり；

R^1 は、H、CHO、 $C_3 \sim C_8$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_1 \sim C_6$ 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、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニルであり；

R^2 および R^3 は、それぞれ独立して H または $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^4 および R^5 は、それぞれ独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ アルコキシであり；

R^6 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ アルコキシであり；

R^7 は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

各 R^8 は、独立してシアノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシまたは $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシであり；

R^9 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニルまたは $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニルであり；

各 R^{10} および R^{11} は、ハロゲン、ニトロ、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_8$ シアノアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ニトロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシハロアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_6 \sim C_{12}$ シクロアルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$

10

20

30

40

50

シクロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $-C(=O)OH$ 、 $C_2 \sim C_8$ アルコシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコシカルボニル、 $-C(=O)NH_2$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ アルキルカルボニルアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニルオキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニルであり；

10

各 G^1 は、独立してフェニルであり；または、6員複素環式環であり、それぞれ、 R^{17} から独立して選択される4個以下の置換基で環員上で置換されているまたは非置換であり；

各 R^{16} および R^{17} は、独立してハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ 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、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_8$ ヒドロキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコシカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルチオであり；

20

u と v の合計は2である、

発明の概要の化合物1。

【0189】

実施形態B。

L は、 $L-1$ 、 $L-2$ または $L-3$ から選択され；

R^A は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_7$ アルコキシもしくは $C_1 \sim C_7$ ハロアルコキシであり；それぞれ、 R^8 から独立して選択される2個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または

30

R^A は、 G^1 であり；

R^B は、 H 、 $-OCH_3$ 、 CF_3 または CH_3 であり；

R^C は、 H 、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^D は、 H 、 CH_3 、 CH_2CH_3 または $-C(=O)CH_3CH_2CH_3$ であり；

R^E は、 H 、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、ホルミル、 $-C(O)NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコシカルボニルまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルであり；

40

R^F は、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニルもしくは $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル；または R^{16} で置換されているまたは非置換のフェニルであり；

R^G は、ホルミル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim$

50

C₁₀シクロアルキルアミノカルボニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、C₃～C₈シクロアルキルスルホニルまたはC₁～C₆アルキルアミノスルホニルであり；

各R⁸は、独立してC₂～C₆アルケニル、C₁～C₆アルコキシまたはC₁～C₆ハロアルコキシであり；

Jは、-CR²R³-または-CR²R³-CR⁴R⁵-であり；

Y¹およびY²は、それぞれ独立してOであり；

R¹は、H、C₃～C₈アルキルカルボニルアルキル、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆シアノアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₄～C₈シクロアルキルアルキル、C₂～C₈アルコキシアルキル、C₂～C₈ハロアルコキシアルキル、C₂～C₈アルキルカルボニル、C₂～C₈ハロアルキルカルボニル、C₄～C₁₀シクロアルキルカルボニル、C₂～C₈アルコキシカルボニルまたはC₂～C₈ハロアルコキシカルボニルであり；

Q¹は、R¹⁰から独立して選択される4個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；または、5～6員複素環式環であり、各環は、炭素原子、ならびに2個以下のO原子、2個以下のS原子および4個以下のN原子から独立して選択される1～4個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、各環は、炭素原子環員上でR¹⁰から独立して選択されるおよび窒素原子環員上でR¹²から独立して選択される4個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；

Q²は、R¹¹から独立して選択される4個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；または、5～6員複素環式環；もしくは8～10員二環式環系であり、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに2個以下のO原子、2個以下のS原子および4個以下のN原子から独立して選択される1～4個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2個以下の炭素環員はC(=O)およびC(=S)から独立して選択され、硫黄原子環員はS(=O)_u(=NR¹⁴)_vから独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上でR¹¹から独立して選択されるおよび窒素原子環員上でR¹³から独立して選択される4個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；

R²およびR³は、それぞれ独立してHまたはCH₃であり；

R⁴およびR⁵は、それぞれ独立してH、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R⁷は、H、F、ClまたはCH₃であり；

R⁹は、H、C₁～C₆アルキル、C₂～C₈アルコキシアルキル、C₂～C₈アルキルカルボニルまたはC₂～C₈アルコキシカルボニルであり；

各R¹⁰およびR¹¹は、独立してハロゲン、C₁～C₈アルキル、C₁～C₈ハロアルキル、C₂～C₈アルコキシアルキル、C₃～C₈アルコキシアルコキシアルキル、C₄～C₁₀シクロアルキルアルキル、C₅～C₁₂アルキルシクロアルキルアルキル、C₃～C₈シクロアルキル、C₃～C₈ハロシクロアルキル、C₆～C₁₂シクロアルキルシクロアルキル、C₃～C₈ハロシクロアルケニル、C₂～C₈ハロアルコキシアルコキシ、C₂～C₈アルコキシアルコキシ、C₄～C₁₀シクロアルコキシアルキル、C₂～C₈アルキルカルボニル、C₂～C₈ハロアルキルカルボニル、C₄～C₁₀シクロアルキルカルボニル、C₂～C₈アルコキシカルボニル、C₄～C₁₀シクロアルコキシカルボニル、C₅～C₁₂シクロアルキルアルコキシカルボニル、C₁～C₈アルコキシ、C₁～C₈ハロアルコキシ、C₂～C₈ハロアルケニルオキシ、C₃～C₈シクロアルコキシ、C₃～C₈ハロシクロアルコキシ、C₄～C₁₀シクロアルキルアルコキシ、C₃～C₁₀アルキルカルボニルアルコキシまたはC₂～C₈ハロアルキルカルボニルオキシであり；

各R¹²およびR¹³は、独立してC₁～C₃アルキル、C₃～C₆シクロアルキルまたはC₂～C₃アルキルカルボニルであり；

各R¹⁴は、独立してHであり；

R¹⁵は、H、CH₃、-(C=O)CH₃または-(C=O)CF₃であり；

各G¹は、独立してフェニルであり、R¹⁷から独立して選択される3個以下の置換基で環員上で置換されているまたは非置換であり；

各 R^{16} および R^{17} は、独立してハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルである、
実施形態 A の化合物。

【0190】

実施形態 C .

L は、L - 1 または L - 2 から選択され；

R^A は、 $C_1 \sim C_7$ アルキルまたは $C_1 \sim C_7$ アルコキシであり；それぞれ、 R^8 から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；

R^B は、H、 $-OCH_3$ または CH_3 であり；

R^C は、H または CH_3 であり；

R^D は、 CH_3 または CH_2CH_3 であり；

R^E は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニルまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルであり；

各 R^8 は、独立して $C_1 \sim C_6$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシであり；

J は、 $-CR^2R^3-$ であり；

Y^1 および Y^2 は、それぞれ独立して O であり；

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキルまたは $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニルであり；

Q^1 は、 R^{10} から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；

Q^2 は、 R^{11} から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；または、炭素原子および 4 個以下の N 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有する 5 ~ 6 員複素環式環であり、ここで、2 個以下の炭素環員は $C(=O)$ および $C(=S)$ から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で R^{11} から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で R^{13} から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；

R^2 および R^3 は、それぞれ独立して H であり；

R^7 は、H または CH_3 であり；

R^9 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニルであり；

各 R^{10} および R^{11} は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシまたは $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルコキシであり；

各 R^{12} および R^{13} は、独立して $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニルである、

実施形態 B の化合物。

【0191】

実施形態 D .

L は、L - 1 から選択され；

R^A は、 $C_1 \sim C_3$ アルキルであり、 R^8 から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；

各 R^8 は、独立して $C_1 \sim C_6$ アルコキシであり；

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキルまたは $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキルであり；

Q^1 は、 R^{10} から独立して選択される 3 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；

Q^2 は、 R^{11} から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；

R^7 は、H であり；

R^9 は、H、 CH_3 または $-C(=O)CH_3$ であり；

各 R^{10} および R^{11} は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシである、

実施形態 C の化合物。

10

【0192】

実施形態 E .

L は、L - 1 から選択され；

R^A は、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシであり、 R^8 から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；

各 R^8 は、独立して $C_1 \sim C_6$ アルコキシであり；

R^1 は、H、 CH_3 、 CH_2CH_3 、シクロプロピル、シクロプロピルメチルまたは CH_2OCH_3 であり；

Q^1 は、 R^{10} から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；

20

Q^2 は、 R^{11} から独立して選択される 3 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；

R^7 は、H であり；

R^9 は、H であり；

各 R^{10} および R^{11} は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシである、

実施形態 C の化合物。

【0193】

本発明の特定の実施形態は、以下から選択される発明の概要の化合物を含む：

(3S, 4R) - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 3 - (ヒドロキシメチル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピロリジンカルボキサミド(シス)；

30

(3R, 4S) - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 3 - (ヒドロキシメチル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピロリジンカルボキサミド(トランス)；

(3S, 4R) - 3 - [(アセチルオキシ)メチル] - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピロリジンカルボキサミド；および

(3S, 4R) - 3 - アセチル - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピロリジンカルボキサミド。

40

【0194】

本発明は更に、本発明の化合物（例えば、本明細書に記載する組成物として）の除草有効量を植生の生息地に施用することを含む、望ましくない植生を防除する方法に関する。使用方法に関する実施形態として注目すべきは、上記実施形態の化合物が関与するものである。本発明の化合物は、コムギ、オオムギ、トウモロコシ、ダイズ、ヒマワリ、ワタ、ナタネおよびイネのような農作物、ならびにサトウキビ、柑橘類、果樹および堅果農作物のような特殊農作物における雑草の選択的な防除に特に有用である。

【0195】

上記実施形態の化合物を含む本発明の除草用組成物も、実施形態として注目に値する。

【0196】

50

本発明は、(a)式1から選択される化合物、そのN-オキシドおよび塩と、(b)(b1)光化学系II阻害剤、(b2)アセトヒドロキシ酸シンターゼ(AHAS)阻害剤、(b3)アセチル-CoAカルボキシラーゼ(ACCase)阻害剤、(b4)オーキシン模倣体、(b5)5-エノール-ピルビルシキミ酸-3-リン酸(EPPS)シンターゼ阻害剤、(b6)光化学系I電子ダイパータ、(b7)プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼ(PPO)阻害剤、(b8)グルタミンシンセターゼ(GS)阻害剤、(b9)超長鎖脂肪酸(VLCFA)エロンガーゼ阻害剤、(b10)オーキシン輸送阻害剤、(b11)フィトエンデサチュラーゼ(PDS)阻害剤、(b12)4-ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPD)阻害剤、(b13)ホモゲンチジン酸ソラネシルトランスフェラーゼ(HST)阻害剤、(b14)セルロース生合成阻害剤、(b15)有糸分裂攪乱物質、有機ヒ素剤、アシュラム、プロモブチド、シンメシリン、クミルロン、ダゾメット、2-[(2,5-ジクロロフェニル)メチル]-4,4-ジメチル-3-イソオキサゾリジノン、ジフェンゾコート、ダイムロン、エトベンザニド、フルレノール、ホサミン、ホサミン-アンモニウム、ヒダントシジン、メタム、メチルダイムロン、オレイン酸、オキサジクロメフォン、ベラルゴン酸およびピリブチカルブを含む他の除草剤、および(b16)除草剤薬害軽減剤；ならびに(b1)~(b16)の化合物の塩から選択される少なくとも1種の追加の有効成分とを含む除草用混合物を更に含む。

【0197】

「光化学系II阻害剤」(b1)は、Q_B結合ニッチにおいてD-1タンパク質に結合し、それにより、葉緑体チラコイド膜におけるQ_AからQ_Bへの電子輸送をブロックする化合物である。光化学系IIを介した受け渡しがブロックされた電子は、一連の反応を介して輸送されて毒性のある化合物を形成し、これが細胞膜を破壊して、葉緑体の膨潤、膜漏出を生じさせ、究極的には細胞破壊をもたらす。Q_B結合ニッチは3つの異なる結合部位を有し：結合部位Aは、アトラジンのようなトリアジン、ヘキサジノンのようなトリアジノン、およびプロマシルのようなウラシルを結合させ、結合部位Bは、ジウロンのようなフェニル尿素を結合させ、結合部位Cは、ペンタゾンのようなベンゾチアジアゾール、プロモキシニルのようなニトリル、およびピリデートのようなフェニルピリダジンを結合させる。光化学系II阻害剤の例としては、アメトリン、アミカルバゾン、アトラジン、ペンタゾン、プロマシル、プロモフェノキシム、プロモキシニル、クロルプロムロン、クロリダゾン、クロロトルロン、クロロクスロン、クミルロン、シアナジン、ダイムロン、デスメディファム、デスメトリン、ジメフロム、ジメタメトリン、ジウロン、エチジムロン、フェヌロン、フルオメツロン、ヘキサジノン、アイオキシニル、イソプロツロン、イソウロン、レナシル、リニユロン、メタミトロン、メタベンズチアズロン、メトプロムロン、メトクスロン、メトリブジン、モノリニユロン、ネブロン、ペンタノクロール、フェンメディファム、プロメトン、プロメトリン、プロパニル、プロパジン、ピリダホル、ピリデート、シデュロン、シマジン、シメトリン、テブチウロン、ターバシル、テルブメトン、テルブチラジン、テルブトリンおよびトリエタジンが挙げられる。

【0198】

「AHAS阻害剤」(b2)は、アセト乳酸シンターゼ(ALS)としても公知のアセトヒドロキシ酸シンターゼ(AHAS)を阻害し、それにより、タンパク質合成および細胞成長に必要なバリン、ロイシンおよびイソロイシンのような分枝鎖脂肪族アミノ酸の産生を阻害して植物を死滅させる化合物である。AHAS阻害剤の例としては、アミドスルフロン、アジムスルフロン、ベンスルフロン-メチル、ビスピリバク-ナトリウム、クロランスラム-メチル、クロリムロン-エチル、クロルスルフロン、シノスルフロン、シクロスルファミロン、ジクロスラム、エタメトスルフロン-メチル、エトキシスルフロン、フラザスルフロン、フロラスラム、フルカルバゾン-ナトリウム、フルメツラム、フルピルスルフロン-メチル、フルピルスルフロン-ナトリウム、ホラムスルフロン、ハロスルフロン-メチル、イマザメタベンゾ-メチル、イマザモキス、イマザピック、イマザピル、イマザキン、イマゼタピル、イマゾスルフロン、ヨードスルフロン-メチル(ナトリウム塩を含む)、イオフェンスルフロン(2-ヨード-N-[(4-メトキシ-6-メチ

10

20

30

40

50

ル - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イル) アミノ] カルボニル] ベンゼンスルホンアミド)、メソスルフロン - メチル、メタゾスルフロン (3 - クロロ - 4 - (5 , 6 - ジヒドロ - 5 - メチル - 1 , 4 , 2 - ジオキサジン - 3 - イル) - N - [[(4 , 6 - ジメトキシ - 2 - ピリミジニル) アミノ] カルボニル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - スルホンアミド)、メトスラム、メトスルフロン - メチル、ニコスルフロン、オキサスルフロン、ペノキスラム、プリミスルフロン - メチル、プロボキシカルバゾン - ナトリウム、プロピリスルフロン (2 - クロロ - N - [[(4 , 6 - ジメトキシ - 2 - ピリミジニル) アミノ] カルボニル] - 6 - プロピルイミダゾ [1 , 2 - b] ピリダジン - 3 - スルホンアミド)、プロスルフロン、ピラゾスルフロン - エチル、ピリベンゾオキシム、ピリフタリド、ピリミノバク - メチル、ピリチオバク - ナトリウム、リムスルフロン、スルホメツロン - メチル、スルホスルフロン、チエンカルバゾン、チフェンスルフロン - メチル、トリアファモン (N - [2 - [(4 , 6 - ジメトキシ - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イル) カルボニル] - 6 - フルオロフェニル] - 1 , 1 - ジフルオロ - N - メチルメタンズルホンアミド)、トリアスルフロン、トリベヌロン - メチル、トリフロキシスルフロン (ナトリウム塩を含む)、トリフルスルフロン - メチルおよびトリトスルフロンが挙げられる。
【 0 1 9 9 】

10

「 A C C a s e 阻害剤 」 (b 3) は、植物における脂質および脂肪酸合成の早期段階の触媒作用を担うアセチル - C o A カルボキシラーゼ酵素を阻害する化合物である。脂質は細胞膜の必須成分であり、脂質なしで新しい細胞を生成することはできない。アセチル C o A カルボキシラーゼの阻害と、その後の脂質産生の不足によって、とりわけ、分裂組織のような活発な成長領域における細胞膜の完全性が失われることとなる。最終的に、苗条および根茎の成長が止まり、苗条分裂組織および根茎芽の枝枯れが始まる。A C C a s e 阻害剤の例としては、アロキシジム、ブトロキシジム、クレトジム、クロジナホップ、シクロキシジム、シハロホップ、ジクロホップ、フェノキサプロップ、フルアジホップ、ハロキシホップ、ピノキサデン、プロホキシジム、プロパキサホップ、キサロホップ、セトキシジム、テブラロキシジムおよびトラルコキシジムが挙げられ、フェノキサプロップ - P、フルアジホップ - P、ハロキシホップ - P およびキサロホップ - P のような分割形態、ならびにクロジナホップ - プロパルギル、シハロホップ - ブチル、ジクロホップ - メチルおよびフェノキサプロップ - P - エチルのようなエステル形態が含まれる。

20

【 0 2 0 0 】

30

オーキシンは、多くの植物組織において成長を制御する植物ホルモンである。「オーキシン模倣体」(b 4) は、植物成長ホルモンであるオーキシンを模倣し、それにより、制御されない無秩序な成長を生じさせ、感受性種における植物死を生じさせる化合物である。オーキシン模倣体の例としては、アミノシクロピラクロル (6 - アミノ - 5 - クロロ - 2 - シクロプロピル - 4 - ピリミジンカルボン酸) とそのメチルエステルおよびエチルエステルならびにそのナトリウム塩およびカリウム塩、アミノピラリド、ベナゾリン - エチル、クロラムベン、クラシホス、クロメプロップ、クロピラリド、ジカンバ、2 , 4 - D、2 , 4 - D B、ジクロルプロップ、フルロキシピル、ハラウキシフェン (4 - アミノ - 3 - クロロ - 6 - (4 - クロロ - 2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) - 2 - ピリジンカルボン酸)、ハラウキシフェン - メチル (メチル 4 - アミノ - 3 - クロロ - 6 - (4 - クロロ - 2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) - 2 - ピリジンカルボキシラート)、M C P A、M C P B、メコプロップ、ピクロラム、キンクロラック、キンメラック、2 , 3 , 6 - T B A、トリクロピル、およびメチル 4 - アミノ - 3 - クロロ - 6 - (4 - クロロ - 2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) - 5 - フルオロ - 2 - ピリジンカルボキシラートが挙げられる。

40

【 0 2 0 1 】

「 E P S P シンターゼ阻害剤 」 (b 5) は、チロシン、トリプトファンおよびフェニルアラニンのような芳香族アミノ酸の合成に関与する酵素である 5 - エノール - ピルビルシキミ酸 - 3 - リン酸シンターゼを阻害する化合物である。E P S P 阻害剤除草剤は、植物群葉を介して容易に吸収され、師部内を成長点へと移動する。グリホサートは、この群に

50

属する比較的非選択的な発生後処理除草剤である。グリホサートとしては、アンモニウム、イソプロピルアンモニウム、カリウム、ナトリウム（セスキナトリウムを含む）およびトリメシウム（代替名：スルホサート）などのエステルおよび塩が挙げられる。

【0202】

「光化学系Ⅰ電子ダイバータ」（b6）は、光化学系Ⅰから電子を受け取り、数サイクル後にヒドロキシルラジカルを生成する化合物である。これらのラジカルは極めて反応性が高く、膜脂肪酸およびクロロフィルを含む不飽和脂質を容易に破壊する。これにより細胞膜の完全性が損なわれ、したがって、細胞および細胞小器官に「漏出」を生じさせ、葉が急速にしおれ、乾燥することとなり、最終的には植物死に至る。この第2のタイプの光合成阻害剤の例としては、ジクワットおよびパラコートが挙げられる。

10

【0203】

「PPO阻害剤」（b7）は、酵素であるプロトポルフィリノーゲンオキシダーゼを阻害して、植物中において、細胞膜を破壊し細胞液を漏出させる反応性の高い化合物を急速に形成させる化合物である。PPO阻害剤の例としては、アシフルオルフェン・ナトリウム、アザフェニジン、ベンズフェンジゾン、ピフェノキス、ブタフェナシル、カルフェントラゾン、カルフェントラゾン・エチル、クロメトキシフェン、シニドン・エチル、シクロピラニル、フルアゾレート、フルフェンピル・エチル、フルミクロラク・ベンチル、フルミオキサジン、フルオログリコフェン・エチル、フルチアセト・メチル、ホメサフェン、ハロサフェン、ラクトフェン、オキサジアルギル、オキサジアゾン、オキシフルオルフェン、ペントキサゾン、プロフルアゾール、ピラクロニル、ピラフルフェン・エチル、サフルフェナシル、スルフェントラゾン、チジアジミン、トリフルジモキサジン（ジヒドロ - 1, 5 - ジメヒル - 6 - チオキソ - 3 - [2, 2, 7 - トリフルオロ - 3, 4 - ジヒドロ - 3 - オキソ - 4 - (2 - プロピン - 1 - イル) - 2 H - 1, 4 - ベンゾオキサジン - 6 - イル] - 1, 3, 5 - トリアジン - 2, 4 (1 H, 3 H) - ジオン）およびチアフェナシル（メチル N - [2 - [[2 - クロロ - 5 - [3, 6 - ジヒドロ - 3 - メチル - 2, 6 - ジオキソ - 4 - (トリフルオロメチル) - 1 (2 H) - ピリミジニル] - 4 - フルオロフェニル] チオ] - 1 - オキソプロピル] - アラニネート）が挙げられる。

20

【0204】

「GS阻害剤」（b8）は、植物がアンモニアのグルタミンへの転換に用いるグルタミンシンセターゼ酵素の活性を阻害する化合物である。したがって、アンモニアが蓄積し、グルタミンレベルが低下する。植物損傷は、おそらく、アンモニアの毒性と他の代謝プロセスに必要なアミノ酸の欠乏との複合効果により生じる。GS阻害剤としては、グルホシネートと、グルホシネート・アンモニウムおよび他のホスフィノトリシン誘導体、グルホシネート・P（（2S）-2-アミノ-4-（ヒドロキシメチルホスフィニル）ブタン酸）およびピラナホスのようなそのエステルおよび塩が挙げられる。

30

【0205】

「VLCAエロンガーゼ阻害剤」（b9）は、エロンガーゼを阻害する多種多様な化学構造を有する除草剤である。エロンガーゼは、VLCAの生合成に関与する、葉緑体中またはその付近に存在する酵素の1種である。植物中で、超長鎖脂肪酸は、葉面における乾燥を防止し、花粉粒に安定性をもたらす疎水性ポリマーの主要構成成分である。このような除草剤としては、アセトクロール、アラクロール、アニロホス、ブタクロール、カフェンストロール、ジメタクロール、ジメテナミド、ジフェナミド、フェノキサスルホン（3 - [[(2, 5 - ジクロロ - 4 - エトキシフェニル) メチル] スルホニル] - 4, 5 - ジヒドロ - 5, 5 - ジメチルイソオキサゾール）、フェントラザミド、フルフェナセット、インダノファン、メフェナセット、メタザクロール、メトラクロール、ナプロアニリド、ナプロパミド、ナプロパミド・M（（2R）-N, N - ジエチル - 2 - (1 - ナフタレニルオキシ) プロパンアミド）、ペトキサミド、ピペロホス、プレチラクロール、プロバクロール、プロピソクロール、ピロキサスルホン、およびテニルクロールが挙げられ、Sメトラクロール、クロロアセタミドおよびオキシアセタミドのような分割形態が含まれる。

40

50

【 0 2 0 6 】

「オーキシン輸送阻害剤」(b 1 0)は、オーキシン担体タンパク質と結合することなどにより植物中のオーキシン輸送を阻害する化学物質である。オーキシン輸送阻害剤の例としては、ジフルフェンゾピル、ナプタラム(N - (1 - ナフチル) - フタルアミド酸および2 - [(1 - ナフタレニルアミノ)カルボニル]安息香酸としても公知である)が挙げられる。

【 0 2 0 7 】

「PDS阻害剤」(b 1 1)は、フィトエンデサチュラーゼ工程におけるカロテノイド生合成経路を阻害する化合物である。PDS阻害剤の例としては、ペフルプタミド、S - ペフルプタミド、ジフルフェニカン、フルリドン、フルクロリドン、フルルタモンノルフルルゾンおよびピコリナフェンが挙げられる。

10

【 0 2 0 8 】

「HPPD阻害剤」(b 1 2)は、4 - ヒドロキシフェニル - ピルビン酸ジオキシゲナーゼの合成の生合成を阻害する化学物質である。HPPD阻害剤の例としては、ベンゾピシクロン、ベンゾフェナブ、ピシクロピロン(4 - ヒドロキシ - 3 - [[2 - [(2 - メトキシエトキシ)メチル] - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジニル]カルボニル]ピシクロ[3 . 2 . 1]オクタ - 3 - エン - 2 - オン)、フェンキノトリオン(2 - [[8 - クロロ - 3 , 4 - ジヒドロ - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - オキソ - 2 - キノキサリニル]カルボニル] - 1 , 3 - シクロヘキサンジオン)、イソキサクロルトール、イソキサフルトール、メソトリオン、ピラスルホトール、ピラゾリネート、ピラゾキシフェン、スルコトリオン、テフリルトリオン、テンボトリオン、トルピラレート(1 - [[1 - エチル - 4 - [3 - (2 - メトキシエトキシ) - 2 - メチル - 4 - (メチルスルホニル)ベンゾイル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル]オキシ]エチルメチルカルボネート)、トブラメゾン、5 - クロロ - 3 - [(2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル)カルボニル] - 1 - (4 - メトキシフェニル) - 2 (1 H) - キノキサリノン、4 - (2 , 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノン、4 - (4 - フルオロフェニル) - 6 - [(2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル)カルボニル] - 2 - メチル - 1 , 2 , 4 - トリアジン - 3 , 5 (2 H , 4 H) - ジオン、5 - [(2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル)カルボニル] - 2 - (3 - メトキシフェニル) - 3 - (3 - メトキシプロピル) - 4 (3 H) - ピリミジノン、2 - メチル - N - (4 - メチル - 1 , 2 , 5 - オキサジアゾール - 3 - イル) - 3 - (メチルスルフィニル) - 4 - (トリフルオロメチル)ベンズアミドおよび2 - メチル - 3 - (メチルスルホニル) - N - (1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル)ベンズアミドが挙げられる。

20

30

【 0 2 0 9 】

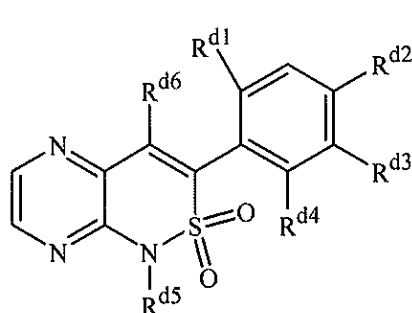
HST阻害剤(b 1 3)は、ホモゲンチジン酸を2 - メチル - 6 - ソラニル - 1 , 4 - ベンゾキノンに変換する植物の能力を攪乱し、それにより、カロテノイド生合成を攪乱する。HST阻害剤の例としては、ハロキシジン、ピリクロル、3 - (2 - クロロ - 3 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 1 , 5 - ナフチリジン - 2 (1 H) - オン、7 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 5 - (2 , 2 - ジフルオロエチル) - 8 - ヒドロキシピリド[2 , 3 - b]ピラジン - 6 (5 H) - オンおよび4 - (2 , 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノンが挙げられる。

40

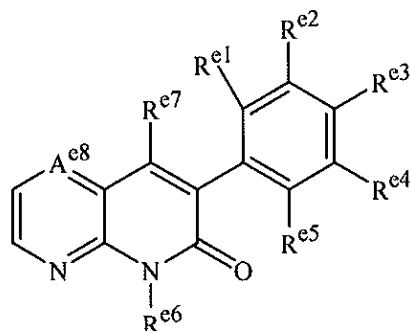
【 0 2 1 0 】

HST阻害剤としては更に、式AおよびBの化合物が挙げられる。

【化 1 2】



A



B

(式中、 R^{d1} は、H、Clまたは CF_3 であり； R^{d2} は、H、ClまたはBrであり； R^{d3} は、HまたはClであり； R^{d4} は、H、Clまたは CF_3 であり； R^{d5} は、 CH_3 、 CH_2CH_3 または CH_2CHF_2 であり； R^{d6} は、OHまたは $-OC(=O)-i-Pr$ であって； R^{e1} は、H、F、Cl、 CH_3 または CH_2CH_3 であり； R^{e2} は、Hまたは CF_3 であり； R^{e3} は、H、 CH_3 または CH_2CH_3 であり； R^{e4} は、H、FまたはBrであり； R^{e5} は、Cl、 CH_3 、 CF_3 、 OCF_3 または CH_2CH_3 であり； R^{e6} は、H、 CH_3 、 CH_2CHF_2 または $CH_2CH_2CH_3$ であり； R^{e7} は、OH、 $-OC(=O)Et$ 、 $-OC(=O)-i-Pr$ または $-OC(=O)-t-Bu$ であり； A^{e8} は、NまたはCHである。)

【0 2 1 1】

「セルロース生合成阻害剤」(b 1 4)は、特定の植物におけるセルロースの生合成を阻害する。若い植物または急速に成長する植物に対して発生前または発生後早期に施用した場合に最も効果的である。セルロース生合成阻害剤の例としては、クロルチアミド、ジクロベニル、フルボキサム、インダジフラム($N^2 - [(1R, 2S) - 2, 3 - ジヒドロ - 2, 6 - ジメチル - 1H - インデン - 1 - イル] - 6 - (1 - フルオロエチル) - 1, 3, 5 - トリアジン - 2, 4 - ジアミン$)、イソキサベンおよびトリアジフラムが挙げられる。

【0 2 1 2】

「他の除草剤」(b 1 5)は、有糸分裂攪乱物質(例えば、フラムプロップ - M - メチルおよびフラムプロップ - M - イソプロピル)、有機ヒ素(例えば、DSMA、およびMSMA)、7, 8 - ジヒドロプテロイン酸シンターゼ阻害剤、葉緑体イソプレノイド合成阻害剤および細胞壁生合成阻害剤のような、多様に異なる作用形態を介して作用する除草剤を含む。他の除草剤は、未知の作用形態を有するか、または、(b 1) ~ (b 1 4)に列挙した特定のカテゴリに属さないか、または、上記に列挙した作用形態の組合せを介して作用する除草剤を含む。他の除草剤の例としては、アクロニフェン、アスラム、アミトロール、プロモブチド、シンメチリン、クロマゾン、クミルウロン、シクロピリモレート(6 - クロロ - 3 - ((2 - シクロプロピル - 6 - メチルフェノキシ) - 4 - ピリダジニル 4 - モルホリンカルボキシレート)、ダイムロン、2 - ((2, 5 - ジクロロフェニル)メチル) - 4, 4 - ジメチル - 3 - イソオキサゾリジノン、ジフェンゾクアット、エトベンザニド、フルオメツロン、フルレノール、ホサミン、ホサミン - アンモニウム、ダゾメット、ジムロン、イプフェンカルバゾン(1 - ((2, 4 - ジクロロフェニル) - N - ((2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 5 - ジヒドロ - N - ((1 - メチルエチル) - 5 - オキソ - 4H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 4 - カルボキサミド)、メタム、メチルジムロン、オレイン酸、オキサジクロメホン、ペラルゴン酸、ピリブチカルブおよび5 - [[(2, 6 - ジフルオロフェニル)メトキシ]メチル] - 4, 5 - ジヒドロ - 5 - メチル - 3 - ((3 - メチル - 2 - チエニル)イソオキサゾール)が挙げられる。「他の除草剤」(b 1 5)には、式(b 1 5 A)の化合物も含まれる

10

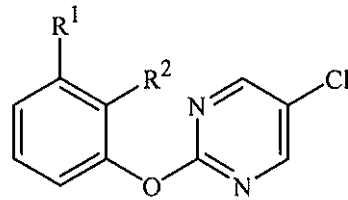
20

30

40

50

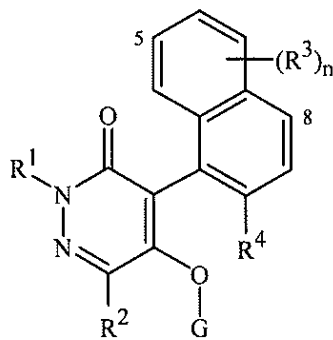
【化 1 3】



(b15A)

(式中、 R^1 は、Cl、BrまたはCNであり； R^2 は、 $C(=O)CH_2CH_2CF_3$ 、 $CH_2CH_2CH_2CH_2CF_3$ または3-CHF₂-イソキサゾール-5-イルである)。「他の除草剤」(b15)には、式(b15B)の化合物も含まれる

【化 1 4】



(b15B)

(式中、 R^1 は、CH₃であり、 R^2 は、Meであり、 R^4 は、OCHF₂であり、Gは、Hであり、nは、0である； R^1 は、CH₃であり、 R^2 は、Meであり、 R^3 は、5-Fであり、 R^4 は、Clであり、Gは、Hであり、nは、1である； R^1 は、CH₃であり、 R^2 は、Clであり、 R^4 は、Meであり、Gは、Hであり、nは、0である； R^1 は、CH₃であり、 R^2 は、Meであり、 R^3 は、5-Meであり、 R^4 は、OCHF₂であり、Gは、Hであり、nは、1である； R^1 は、CH₃であり、 R^2 は、Meであり、 R^3 は、5-Brであり、 R^4 は、OCHF₂であり、Gは、Hであり、nは、1である； R^1 は、CH₃であり、 R^2 は、Meであり、 R^3 は、5-Clであり、 R^4 は、Clであり、Gは、Hであり、nは、1である；または、 R^1 は、CH₃であり、 R^2 は、CH₃であり、 R^4 は、OCHF₂であり、Gは、C(O)Meであり、nは、0である)。

【0213】

「他の除草剤」(b15)には、式(b15C)の化合物も含まれる

10

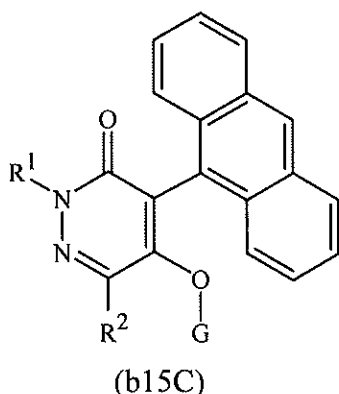
20

30

40

50

【化 1 5】



10

(式中、

R¹は、CH₃であり、R²は、Clであり、Gは、Hである；またはR¹は、CH₃であり、R²は、Clであり、Gは、C(O)Meである)。

【0214】

「除草剤薬害軽減剤」(b16)は、特定の農作物に対する除草剤の植物毒性効果を排除または低減するために、除草剤製剤に添加される物質である。これらの化合物は、除草剤による被害から農作物を保護するが、典型的には、除草剤による望ましくない植生の防除を妨げないものである。除草剤薬害軽減剤の例としては、ベノキサコール、クロキントセト-メキシル、クミルウロン、シオメトリニル、シプロスルファミド、ダイムロン、ジクロロミド、ジシクロノン、ジエトレート、ジメピペレート、フェンクロラゾール-エチル、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン-エチル、メフェンピル-ジエチル、メフェネート、メトキシフェノン、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、N-(アミノカルボニル)-2-メチルベンゼンスルホンアミドおよびN-(アミノカルボニル)-2-フルオロベンゼンスルホンアミド、1-ブロモ-4-[(クロロメチル)スルホニル]ベンゼン、2-(ジクロロメチル)-2-メチル-1,3-ジオキサラン(MG 191)、4-(ジクロロアセチル)-1-オキサ-4-アゾスピロ[4.5]デカン(MON 4660)、2,2-ジクロロ-1-(2,2,5-トリメチル-3-オキサゾリジニル)-エタノンおよび2-メトキシ-N-[[4-[[[(メチルアミノ)カルボニル]アミノ]フェニル]スルホニル]-ベンズアミド]が挙げられるが、これらに限定されない。

20

30

【0215】

式1の化合物は、有機合成化学の技術分野で公知の一般的な方法によって製造可能である。注目すべきは、スキーム1~15に記載の下記の方法およびそれらの変形である。以下の式1~2の化合物におけるR¹、R⁷、R⁹、Q¹、Q²、Y¹、Y²、JおよびWの定義は、特に断りのない限り、発明の概要において上記に定義されている通りである。式1A~1Fは、式1の化合物の様々な部分集合である。各部分集合の式に係る置換基は、特に断りのない限りその親式に関して定義されている通りである。

40

【0216】

スキーム1に示すように、式1の化合物は、式2の化合物と求電子試薬との反応によって製造することができる。付加および置換反応は、化学量論量、超化学量論量または触媒量の塩基の存在下で、典型的には共溶媒の存在下で実施される。反応のための適切な塩基としては、水素化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、炭酸セシウム、炭酸カリウム、カリウムtert-ブトキシド、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビス(トリメチルシリル)アミド、ナトリウムビス(トリメチルシリル)アミド、カリウムビス(トリメチルシリル)アミド、ピリジン、トリエチルアミン、およびN,N-ジイソプロピルエチルアミンが挙げられるが、これに限定されない。反応のための適

50

切な求電子試薬としては、塩化アシル、アシル無水物、クロロホルマート、シアノホルマート、イソシアナート、アルデヒド、ケトン、イミン、イミニウムハライド、電子不足アルケン（アクリラート、アクリルアミド、アクリロニトリル、ビニルケトン、およびビニルスルホンのような）、アルキルハライド、およびアルキルスルホナートが挙げられるが、これに限定されない。典型的には、反応は、水、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、ジメチルスルホキシド、N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセトアミド、N - メチルピロリジノンおよびアセトニトリル、またはこれらの混合物のような溶媒中、 -78°C から溶媒の還流温度までの範囲の温度で行われる。リチウムビス（トリメチルシリル）アミドと塩化アセチルを利用する、L が L - 1 である式 1 の化合物の製造のためのスキーム 1 の方法が、合成例 3 の工程 A により例示される。触媒量の水酸化カリウムとパラホルムアルデヒドを利用する、L が L - 3 である式 1 の化合物の製造のためのスキーム 1 の方法が、合成例 1 の工程 A により例示される。

【 0 2 1 7 】

【 化 1 6 】

スキーム 1



【 0 2 1 8 】

スキーム 2 に示すように、式 1 B の化合物（即ち、L が L - 3 であり、R^F が H 以外である式 1 の化合物）は、式 1 A のアルコール（即ち、L が L - 3 であり、R^F が H である式 1 の化合物）と求電子試薬との反応によって製造することができる。反応は、適切な塩基の存在下で、典型的には共溶媒の存在下で実施される。反応のための適切な塩基としては、水素化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、炭酸セシウム、炭酸カリウム、カリウム *tert* - ブトキシド、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビス（トリメチルシリル）アミド、ナトリウムビス（トリメチルシリル）アミド、カリウムビス（トリメチルシリル）アミド、ピリジン、トリエチルアミン、および N, N - ジイソプロピルエチルアミンが挙げられるが、これに限定されない。反応のための適切な求電子試薬としては、塩化アシル、アシル無水物、クロロホルマート、シアノホルマート、イソシアナート、塩化スルホニル、塩化スルフィニル、および塩化ホスホリルが挙げられるが、これに限定されない。典型的には、反応は、水、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、ジメチルスルホキシド、N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセトアミド、N - メチルピロリジノンおよびアセトニトリルまたはこれらの混合物のような溶媒中で、 -78°C から溶媒の還流温度までの範囲の温度で行われる。ピリジンと塩化アセチルを利用した、L が L - 3 である式 1 A の化合物の製造のためのスキーム 2 の方法が、合成例 2 の工程 A により例示される。

【 0 2 1 9 】

10

20

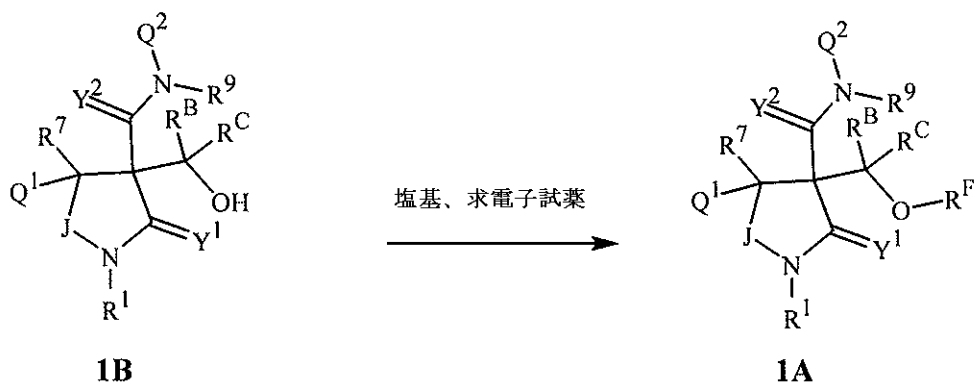
30

40

50

【化 17】

スキーム 2



10

【0220】

スキーム 3 に示すように、式 1 D の化合物（即ち、L が L - 2 であり、R^D が H 以外である式 1 の化合物）は、式 1 C の化合物（即ち、L が L - 2 であり、R^D が H である式 1 の化合物）と求電子試薬との反応によって製造することができる。反応は、適切な塩基の存在下で、典型的には共溶媒の存在下で実施される。反応のための適切な塩基としては、水素化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、炭酸セシウム、炭酸カリウム、カリウム *tert* - ブトキシド、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビス（トリメチルシリル）アミド、ナトリウムビス（トリメチルシリル）アミド、カリウムビス（トリメチルシリル）アミド、ピリジン、トリエチルアミン、および N, N - ジイソプロピルエチルアミンが挙げられるが、これに限定されない。反応のための適切な求電子試薬としては、塩化アシル、アシル無水物、クロロホルマート、シアノホルマート、イソシアナート、電子不足アルケン（アクリラート、アクリルアミド、アクリロニトリル、ビニルケトン、およびビニルスルホンのような）、アルキルハライド、アルキルスルホナート、塩化スルホニル、塩化スルフィニル、および塩化ホスホリルが挙げられるが、これに限定されない。典型的には、反応は、水、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、ジメチルスルホキシド、N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセトアミド、N - メチルピロリジノンおよびアセトニトリルまたはこれらの混合物のような溶媒中で、- 78 から溶媒の還流温度までの範囲の温度で行われる。

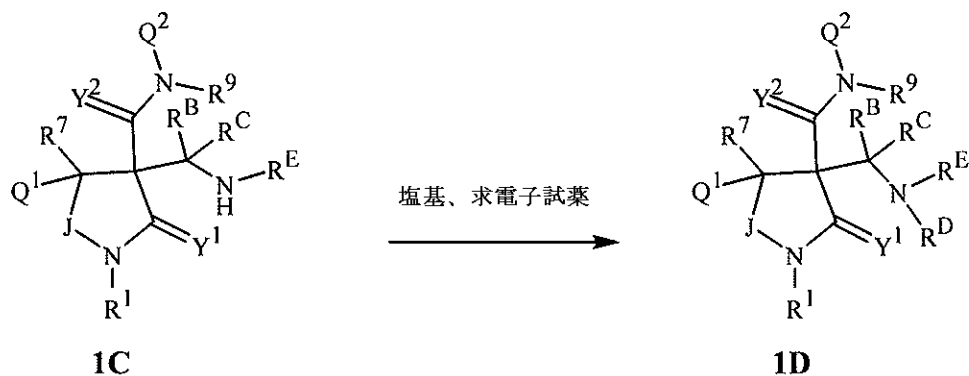
20

30

【0221】

【化 18】

スキーム 3



40

【0222】

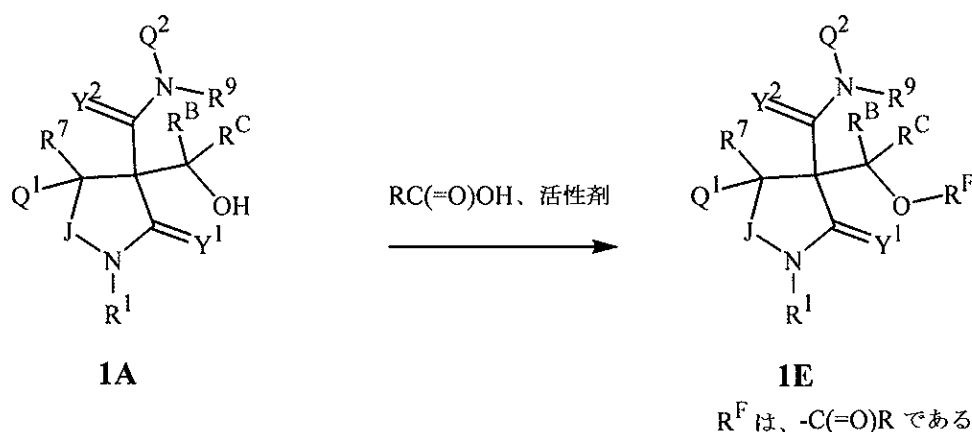
50

スキーム 4 に示すように、式 1 E の化合物（即ち、L が L - 3 であり、R^F が C(=O)R である式 1 の化合物であり、ここで、カルボニルに結合した原子は炭素である）はまた、プロピルホスホン酸無水物、ジシクロヘキシルカルボジイミド、N - (3 - ジメチルアミノプロピル) - N' - エチルカルボジイミド、N, N' - カルボニルジイミダゾール、2 - クロロ - 1, 3 - ジメチルイミダゾリウムクロリドまたは 2 - クロロ - 1 - メチルピリジニウムヨージドのような脱水性カップリング試薬の存在下で、場合により N, N - ジメチル - 4 - アミノピリジンのような触媒の存在下でのカルボン酸と式 1 A のアルコール（即ち、L が L - 3 であり、R^F が H である式 1 の化合物）との反応によって製造することができる。ポリマー担持シクロヘキシルカルボジイミドのようなポリマー担持試薬も、適している。これらの反応は、ジクロロメタン、アセトニトリル、N, N - ジメチルホルムアミドまたは酢酸エチルのような溶媒中、トリエチルアミン、N, N - ジイソプロピルアミンまたは 1, 8 - ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ - 7 - エンのような塩基の存在下で、0 から溶媒の沸点までの範囲の温度で典型的には行われる。

【0223】

【化19】

スキーム 4



【0224】

スキーム 5 に示すように、式 1 F の化合物（即ち、L が L - 2 であり、R^D が C(O)R である式 1 の化合物であり、ここで、カルボニルに結合した原子は炭素である）はまた、プロピルホスホン酸無水物、ジシクロヘキシルカルボジイミド、N - (3 - ジメチルアミノプロピル) - N' - エチルカルボジイミド、N, N' - カルボニルジイミダゾール、2 - クロロ - 1, 3 - ジメチルイミダゾリウムクロリドまたは 2 - クロロ - 1 - メチルピリジニウムヨージドのような脱水性カップリング試薬の存在下でのカルボン酸と式 1 C の化合物（即ち、L が L - 2 であり、R^D が H である式 1 の化合物）との反応によって製造することができる。ポリマー担持シクロヘキシルカルボジイミドのようなポリマー担持試薬も、適している。これらの反応は、ジクロロメタン、アセトニトリル、N, N - ジメチルホルムアミドまたは酢酸エチルのような溶媒中、トリエチルアミン、N, N - ジイソプロピルアミンまたは 1, 8 - ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ - 7 - エンのような塩基の存在下で、0 ~ 60 の範囲の温度で典型的には行われる。プロピルホスホン酸無水物を採用したカップリング条件については、Organic Process Research & Development 2009、13、900 ~ 906 頁を参照されたい。

【0225】

10

20

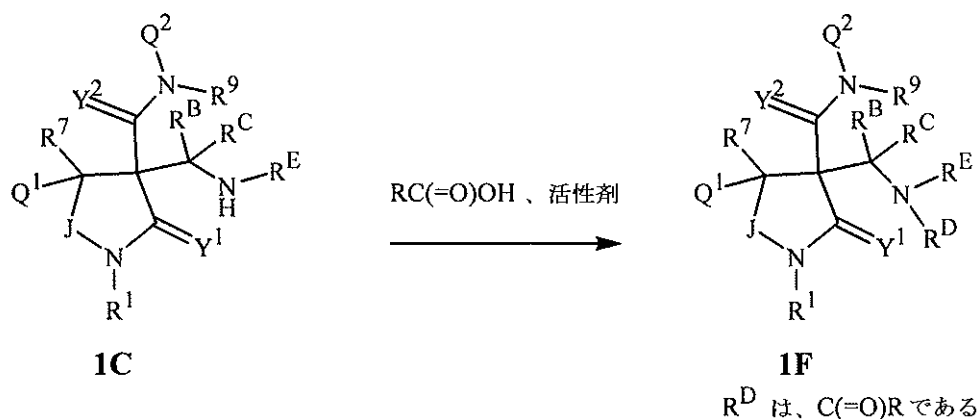
30

40

50

【化 2 0】

スキーム 5



10

【0226】

当業者であれば認識することであるが、様々な官能基を他の官能基に変換して異なる式1の化合物を得ることが可能である。官能基の相互変換を単純にわかりやすく例示している貴重な資料としては、Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations、第2版、Wiley-VCH、New York、1999を参照されたい。例えば、式1の化合物の製造のための中間体は、芳香族ニトロ基を含有していてもよく、これをアミノ基に還元し、次いで、ザンドマイヤー反応のような当技術分野で周知の反応を介して様々なハロゲン化物に変換して式1の化合物をもたらすことが可能である。上記の反応はまた、多くの事例において、代替的な順序で実行可能である。

20

【0227】

式1の化合物の製造について上述した試薬および反応条件の一部は、中間体に存在する特定の官能基には適合しない可能性があることが認識されている。そうした事例においては、保護/脱保護手順または官能基相互変換を合成に組み込むことが、所望の生成物の入手に役立つ。保護基の使用および選択は、化学合成における当業者には明らかである（例えば、Greene, T.W.; Wuts, P.G.M. Protective Groups in Organic Synthesis、第2版; Wiley: New York、1991を参照されたい）。当業者であれば認識することであるが、場合によっては、式1の化合物の合成を完了させるために、個々のスキームのいずれかにおいて示されているような所与の試薬を導入した後、詳細には記載されていない追加の慣例的な合成工程を実施する必要がある場合がある。当業者であれば更に認識することであるが、上記のスキームに例示されている工程の組合せを、式1の化合物を製造するために特に示唆されている順序以外の順序で実施する必要がある場合がある。

30

【0228】

当業者であれば更に認識することであるが、本明細書に記載の式1の化合物および中間体は、置換基を付加するために、または、既存の置換基を修飾するために、様々な求電子性反応、求核性反応、ラジカル反応、有機金属反応、酸化反応および還元反応に供することが可能である。

40

【0229】

更なる詳細がなくても、先行する記載を使用する当業者は、本発明を最大限に利用可能であると考えられる。以下の非限定的な実施例は本発明を例示するものである。以下の実施例における工程は、合成変換全体における各工程のための手法を例示するものであり、各工程のための出発材料は、必ずしも、手法が他の実施例または工程において記載されている特定の製造実験によって製造されていなくてもよい。パーセンテージは、クロマトグ

50

ラフ溶媒混合物の場合、または、他に記載のある場合を除き、重量基準である。クロマトグラフ溶媒混合物に対する部およびパーセンテージは、別段の指示がない限り体積基準である。¹H NMRスペクトルは、特に断りのない限り500 MHzにおけるCDCl₃中のテトラメチルシランからの低磁場側のppmで報告されており、「s」は一重項を意味し、「d」は二重項を意味し、「t」は三重項を意味し、「q」は四重項を意味し、「m」は多重項を意味し、「dd」は二重項の二重項を意味し、「dt」は三重項の二重項を意味し、「br s」は広幅一重項を意味する。

【0230】

合成例 1

(3S, 4R) - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 3 - (ヒドロキシメチル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 3 - ピロリジンカルボキサミド (化合物4および5) の製造

10

工程A: (3S, 4R) - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 3 - (ヒドロキシメチル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 3 - ピロリジンカルボキサミドの製造

(3S, 4S) - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 3 - ピロリジンカルボキサミド (0.80 g、2.0 mmol)、パラホルムアルデヒド (0.072 g、2.4 mmol) および水酸化カリウム (0.002 g、0.04 mmol) の溶液をテトラヒドロフラン (16 mL) に添加し、溶媒の還流温度に30分間加熱した。反応混合物を濃縮して粗生成物を得た。粗生成物をヘキサン中0% ~ 100%の酢酸エチルで溶出するカラムクロマトグラフィーにより精製し、本発明の化合物である表題化合物を無色油 (0.20 g) として、本発明の化合物であるそのジアステレオマー ((3R, 4R) - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 3 - (ヒドロキシメチル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 3 - ピロリジンカルボキサミド) を無色固体 (0.60 g) として得た。

20

¹H NMR 10.22 (br s, 1H), 7.52 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 7.50-7.45 (m, 1H), 7.33 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 6.99-6.82 (m, 2H), 4.18-4.08 (m, 1H), 4.07-4.00 (m, 1H), 3.98-3.83 (m, 2H), 3.56-3.48 (m, 1H), 3.15-3.11 (m, 1H), 3.07 (s, 3H).

ジアステレオマー: ¹H NMR 10.27 (br s, 1H), 8.03-7.97 (m, 1H), 7.72 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.64 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.08-6.99 (m, 1H), 6.95-6.86 (m, 1H), 4.40-4.33 (m, 1H), 3.91-3.64 (m, 4H), 3.08 (s, 3H), 2.24-2.20 (m, 1H).

30

【0231】

合成例 2

(3S, 4R) - 3 - [(アセチルオキシ)メチル] - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 3 - ピロリジンカルボキサミド (化合物2) の製造

工程A: (3S, 4R) - 3 - [(アセチルオキシ)メチル] - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 3 - ピロリジンカルボキサミドの製造

40

(3S, 4R) - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 3 - (ヒドロキシメチル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 3 - ピロリジンカルボキサミドおよび (3R, 4R) - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 3 - (ヒドロキシメチル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 3 - ピロリジンカルボキサミド (即ち、合成例1の生成物) (0.080 g、0.19 mmol) とピリジン (0.020 mL、0.22 mmol) を、ジクロロメタン (1.0 mL) に溶解させた。塩化アセチル (0.015 mL、0.22 mmol) を添加し、溶液を23で20分間撹拌した。反応混合物をシリカゲル上に濃縮し、ヘキサン中0% ~ 50%酢酸エチルで溶出するカラムクロマトグラフィーにより精製して、本発明の化合物である表題化合物を淡黄色油 (0.045 g) として得た。

50

^1H NMR 10.51 (br s, 1H), 7.55-7.44 (m, 3H), 7.31-7.26 (m, 2H), 6.94-6.81 (m, 2H), 4.81 (d, $J = 10.9$ Hz, 1H), 4.47 (d, $J = 10.9$ Hz, 1H), 4.06-3.98 (m, 1H), 3.65-3.59 (m, 1H), 3.35-3.29 (m, 1H), 3.05 (s, 3H), 2.10 (s, 3H).

【0232】

合成例3

(3S, 4R) - 3 - アセチル - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 3 - ピロリジンカルボキサミド (化合物1) の製造

工程A: (3S, 4R) - 3 - アセチル - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 3 - ピロリジンカルボキサミドの製造

(3S, 4S) - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 3 - ピロリジンカルボキサミド (0.10 g, 0.25 mmol) をテトラヒドロフラン (10 mL) に溶解させ、0 に冷却した。リチウムビス(トリメチルシリル)アミドのテトラヒドロフラン (1.0 M, 0.50 mL, 0.50 mmol) 溶液を添加し、0 で10分間撹拌した。塩化アセチル (0.020 mL, 0.28 mmol) を添加した。反応物を23 に加温し、20分間撹拌した。反応混合物をシリカゲル上に濃縮し、ヘキサン中0% ~ 50% 酢酸エチルで溶出するカラムクロマトグラフィーにより精製して、本発明の化合物である表題化合物を無色固体 (0.021 g) として得た。

^1H NMR 10.62 (br s, 1H), 7.51 (d, $J = 8.0$ Hz, 2H), 7.40-7.33 (m, 1H), 7.28 (d, $J = 8.2$ Hz, 2H), 6.95-6.84 (m, 2H), 4.38-4.34 (m, 1H), 4.04-3.98 (m, 1H), 3.06 (s, 3H), 2.42 (s, 3H).

【0233】

当技術分野で公知の方法を伴う本明細書に記載の手法により、表1 ~ 1008の以下の化合物が製造可能である。以下の表において、以下の略語が使用されている: i はイソを意味し、c はシクロを意味し、Me はメチルを意味し、Et はエチルを意味し、Pr はプロピルを意味し、Bu はブチルを意味し、c-Pr はシクロプロピルを意味し、c-Bu はシクロブチルを意味し、Ph はフェニルを意味し、OMe はメトキシを意味し、OEt はエトキシを意味し、Py はピリジニルを意味し、-NO₂ はニトロを意味する。

【0234】

10

20

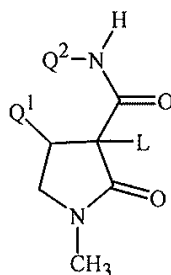
30

40

50

【表 1】

表 1



10

L は、L-1 であり;R^A は、Me であり;Q² は、Ph(2-F)であり;Q¹ は、以下の通りである。

Q ¹	Q ¹	Q ¹	
Ph(3-Cl)	Ph(2,3-ジ-F)	2-Py(6-F)	
Ph(3-F)	Ph(2,4-ジ-F)	2-Py(6-CF ₃)	
Ph(3-Br)	Ph(2,5-ジ-F)	2-Py(6-Me)	
Ph(3-Me)	Ph(2,6-ジ-F)	2-Py(5-F)	20
Ph(3-CF ₃)	Ph(3,4-ジ-F)	2-Py(5-CF ₃)	
Ph(3-CHF ₂)	Ph(3,5-ジ-F)	2-Py(5-Me)	
Ph(3-CH ₂ F)	Ph(3-Me,4-F)	2-Py(4-F)	
Ph(3-OCF ₃)	Ph(3-F,4-Me)	2-Py(4-CF ₃)	
Ph(3-OCF ₂ H)	Ph(3-CF ₃ ,4-F)	2-Py(4-Me)	
Ph(3-OMe)	Ph(3-F,4-CF ₃)	2-Py(3-F)	
Ph(3-OCF ₂ CF ₂ H)	Ph(3-CHF ₂ ,4-F)	2-Py(3-CF ₃)	
Ph(4-Cl)	Ph(3-CH ₂ F,4-F)	2-Py(3-Me)	
Ph(4-F)	Ph(3,5-ジ-Et)	3-Py	30
Ph(4-Br)	Ph(3-Me,5-Ome)	3-Py(6-F)	
Ph(4-Me)	Ph(3,5-ジ-Ome)	3-Py(6-CF ₃)	
Ph(4-CF ₃)	Ph(3-Ome,5-Oet)	3-Py(6-Me)	
Ph(4-CHF ₂)	Ph(3-Me,5-CH ₂ F)	3-Py(5-F)	
Ph(4-CH ₂ F)	Ph(3-Ome,5-CH ₂ F)	3-Py(5-CF ₃)	
Ph(4-OCF ₃)	Ph(3-Oet,5-CH ₂ F)	3-Py(5-Me)	
Ph(4-OCF ₂ H)	Ph(2,3,4-トリ-F)	3-Py(4-F)	
Ph(4-OMe)	Ph(3,4,5-トリ-F)	3-Py(4-CF ₃)	
Ph(4-OCF ₂ CF ₂ H)	2-Py	3-Py(4-Me)	40

50

【表 2】

Q ¹	Q ¹	
3-Py(2-F)	ピラジン-2-イル(5-CF ₃)	
3-Py(2-CF ₃)	ピリミジン-2-イル	
3-Py(2-Me)	ピリミジン-2-イル(5-CF ₃)	
4-Py	ピリミジン-5-イル	
4-Py(3-F)	ピリミジン-5-イル(2-CF ₃)	
4-Py(3-CF ₃)	1,3-ジオキソラン-4-イル	
4-Py(3-Me)	2,2-ジ-F-1,3-ジオキソラン	10
4-Py(2-F)	-4-イル	
4-Py(2-CF ₃)		
4-Py(2-Ome,6-Oet)		
4-Py(2-Me,6-F)		
4-Py(2-Ome,6-F)		
4-Py(2-Oet,6-F)		
4-Py(2,6-ジ-F)		
4-Py(2-Me,6-CH ₂ F)		
4-Py(2-Ome,6-CH ₂ F)		20
4-Py(2-Oet,6-CH ₂ F)		
4-Py(2-F,6-CH ₂ F)		
4-Py(2-Me,6-OCHF ₂)		
4-Py(2-Ome,6-OCHF ₂)		
4-Py(2-Oet,6-OCHF ₂)		
4-Py(2-F,6-OCHF ₂)		
2-チエニル		
2-チエニル(4-CF ₃)		
2-チエニル(5-CF ₃)		
3-チエニル		30
3-チエニル(4-CF ₃)		
3-チエニル(5-CF ₃)		
2-フリル		
2-フリル(4-CF ₃)		
2-フリル(5-CF ₃)		
3-フリル		
3-フリル(4-CF ₃)		
3-フリル(5-CF ₃)		
ピラジン-2-イル		40

【0235】

表 2 は、表題行「L は、L - 1 であり；R^A は、Me であり；Q² は、Ph (2 - F) であり；Q¹ は、以下の通りである」が、以下の表 2 に列挙する表題行（即ち、「L は、L - 1 であり；R^A は、Me であり；Q² は、Ph (2 , 3 - ジ - F) であり；Q¹ は、以下の通りである」）に置き換えられていることを除き、表 1 と同様に構成されている。したがって、表 2 の最初の項目は、J は、- CH₂ - であり；Q² は、Ph (2 , 3 - ジ - F) であり；Q¹ は、Ph (3 - Cl)（即ち、3 - クロロフェニル）であり；Y¹ は、O であり；Y² は、O であり；R⁷ は、H であり；L は、L - 1 であり；R^A は、Me である、式 1 の化合物となる。表 3 ~ 16 も同様に構成されている。

【 0 2 3 6 】

【表 3】

表	表題行
2	Lは、L-1であり;R ^A は、Meであり;Q ² は、Ph(2,3-ジ-F)であり;Q ¹ は、以下の通りである
3	Lは、L-1であり;R ^A は、Meであり;Q ² は、Ph(2,4-ジ-F)であり;Q ¹ は、以下の通りである
4	Lは、L-1であり;R ^A は、Meであり;Q ² は、Ph(2,3,4-トリ-F)であり;Q ¹ は、以下の通りである
5	Lは、L-1であり;R ^A は、Meであり;Q ² は、Ph(2-CF ₃)であり;Q ¹ は、以下の通りである
6	Lは、L-1であり;R ^A は、Meであり;Q ² は、Ph(2-Me)であり;Q ¹ は、以下の通りである
7	Lは、L-1であり;R ^A は、Meであり;Q ² は、Ph(2-NO ₂)であり;Q ¹ は、以下の通りである
8	Lは、L-1であり;R ^A は、Meであり;Q ² は、Ph(2-Cl)であり;Q ¹ は、以下の通りである
9	Lは、L-1であり;R ^A は、Meであり;Q ² は、Ph(2-SO ₂ Me)であり;Q ¹ は、以下の通りである
10	Lは、L-1であり;R ^A は、Meであり;Q ² は、Ph(2-F,3-Cl)であり;Q ¹ は、以下の通りである
11	Lは、L-1であり;R ^A は、Meであり;Q ² は、Ph(2-SOMe)であり;Q ¹ は、以下の通りである
12	Lは、L-1であり;R ^A は、Meであり;Q ² は、Ph(2-SMe)であり;Q ¹ は、以下の通りである
13	Lは、L-1であり;R ^A は、Meであり;Q ² は、Ph(2-Me,3-F)であり;Q ¹ は、以下の通りである
14	Lは、L-1であり;R ^A は、Meであり;Q ² は、3-ピリジニル(2,6-ジ-F)であり;Q ¹ は、以下の通りである
15	Lは、L-1であり;R ^A は、MEであり;Q ² は、3-ピリジニル(2-F)であり;Q ¹ は、以下の通りである
16	Lは、L-1であり;R ^A は、MEであり;Q ² は、2-ピリジニル(6-F)であり;Q ¹ は、以下の通りである

10

20

30

40

【 0 2 3 7 】

50

【表 4】

表 33～1008

表33～1008は、Lの識別情報に言及する表題行の部分「Lは、L-1であり;R^Aは、Meである」が、以下の表33～48に列挙するLの識別情報に言及する表題行の部分(即ち、「Lは、L-1であり;R^Aは、Etである」)に置き換えられていることを除き、表1～16と同様に構成されている。したがって、表33の最初の項目は、Jは、-CH₂-であり;Q²は、Ph(2,3-ジ-F)であり;Q¹は、Ph(3-Cl)(即ち、3-クロロフェニル)であり;Y¹は、Oであり;Y²は、Oであり;R⁷は、Hであり;R⁹は、Hであり;Lは、L-1であり;R^Aは、Etである式1の化合物となる。

表	表題行
33-48	Lは、L-1であり;R ^A は、Etである
49-64	Lは、L-1であり;R ^A は、 <i>n</i> -Prである
65-80	Lは、L-1であり;R ^A は、 <i>i</i> -Prである
81-96	Lは、L-1であり;R ^A は、 <i>c</i> -Prである
97-112	Lは、L-1であり;R ^A は、 <i>n</i> -Buである
113-128	Lは、L-1であり;R ^A は、CF ₃ である
129-144	Lは、L-1であり;R ^A は、CCl ₃ である
145-160	Lは、L-1であり;R ^A は、Phである
161-176	Lは、L-1であり;R ^A は、Ph(2-Me)である
177-192	Lは、L-1であり;R ^A は、Ph(3-Me)である
193-208	Lは、L-1であり;R ^A は、Ph(4-Me)である
209-224	Lは、L-1であり;R ^A は、OMeである
225-240	Lは、L-1であり;R ^A は、OEtである
241-256	Lは、L-2であり;R ^B は、Hであり;R ^C は、Hであり;R ^D は、Hであり; R ^E は、Meである
257-272	Lは、L-2であり;R ^B は、Hであり;R ^C は、Hであり;R ^D は、Hであり; R ^E は、Etである
273-288	Lは、L-2であり;R ^B は、Hであり;R ^C は、Hであり;R ^D は、Hであり; R ^E は、 <i>n</i> -Prである
289-304	Lは、L-2であり;R ^B は、Hであり;R ^C は、Hであり;R ^D は、Hであり; R ^E は、 <i>c</i> -Prである
305-320	Lは、L-2であり;R ^B は、Hであり;R ^C は、Hであり;R ^D は、Hであり; R ^E は、COMeである
321-336	Lは、L-2であり;R ^B は、Hであり;R ^C は、Hであり;R ^D は、Hであり; R ^E は、COPhである

10

20

30

40

50

【表 5】

337-352	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、H であり; R ^E は、COOMe である
353-368	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、H であり; R ^E は、COOEt である
369-384	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、H であり; R ^E は、SO ₂ Me である
385-400	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、H であり; R ^E は、SO ₂ Ph である
401-416	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Me であり; R ^E は、Me である
417-432	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Me であり; R ^E は、Et である
433-448	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Me であり; R ^E は、 <i>n</i> -Pr である
449-464	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Me であり; R ^E は、 <i>c</i> -Pr である
465-480	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Me であり; R ^E は、COMe である
481-496	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Me であり; R ^E は、COPh である
497-512	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Me であり; R ^E は、COOMe である
513-528	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Me であり; R ^E は、COOEt である
529-544	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Me であり; R ^E は、SO ₂ Me である
545-560	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Me であり; R ^E は、SO ₂ Ph である
561-576	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Et であり; R ^E は、Me である
577-592	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Et であり; R ^E は、Et である
593-608	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Et であり; R ^E は、 <i>n</i> -Pr である
609-624	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Et であり; R ^E は、 <i>c</i> -Pr である
625-640	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Et であり; R ^E は、COMe である
641-656	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Et であり; R ^E は、COPh である

10

20

30

40

50

【表 6】

657-672	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Et であり; R ^E は、COOMe である
673-688	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Et であり; R ^E は、COOEt である
689-704	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Et であり; R ^E は、SO ₂ Me である
705-720	L は、L-2 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^D は、Et であり; R ^E は、SO ₂ Ph である
721-736	L は、L-3 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^F は、COMe である
737-752	L は、L-3 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^F は、COCF ₃ である
753-768	L は、L-3 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^F は、COPh である
769-784	L は、L-3 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^F は、COOMe である
785-800	L は、L-3 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^F は、COOEt である
801-816	L は、L-3 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^F は、SO ₂ Me である
817-832	L は、L-3 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^F は、SO ₂ Ph である
833-848	L は、L-3 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^F は、PO(OH) ₂ である
849-864	L は、L-3 であり; R ^B は、H であり; R ^C は、H であり; R ^F は、PO(OMe) ₂ である
865-880	L は、L-4 であり; R ^B の両方は、それぞれ H であり; R ^C の両方は、 それぞれ H であり; R ^G は、COMe である
881-896	L は、L-4 であり; R ^B の両方は、それぞれ H であり; R ^C の両方は、 それぞれ H であり; R ^G は、COCF ₃ である
897-912	L は、L-4 であり; R ^B の両方は、それぞれ H であり; R ^C の両方は、 それぞれ H であり; R ^G は、COPh である
913-928	L は、L-4 であり; R ^B の両方は、それぞれ H であり; R ^C の両方は、 それぞれ H であり; R ^G は、COOMe である
929-944	L は、L-4 であり; R ^B の両方は、それぞれ H であり; R ^C の両方は、 それぞれ H であり; R ^G は、COOEt である
945-960	L は、L-4 であり; R ^B の両方は、それぞれ H であり; R ^C の両方は、 それぞれ H であり; R ^G は、SO ₂ Me である
961-976	L は、L-4 であり; R ^B の両方は、それぞれ H であり; R ^C の両方は、 それぞれ H であり; R ^G は、SO ₂ Ph である

10

20

30

40

【表 7】

977-992	L は、L-4 であり; R ^B の両方は、それぞれ H であり; R ^C の両方は、 それぞれ H であり; R ^G は、PO(OH) ₂ である
993-1008	L は、L-4 であり; R ^B の両方は、それぞれ H であり; R ^C の両方は、 それぞれ H であり; R ^G は、PO(OMe) ₂ である

本発明の化合物は一般的に、担体として機能する界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも１種の追加の成分と共に、組成物、即ち、製剤中の除草用有効成分として使用される。製剤または組成物の原材料は、有効成分の物理学的性質、施用形態、および土壌のタイプ、水分および温度のような環境要因と調和するように選択される。

【 0 2 3 9 】

有用な製剤は、液体組成物および固体組成物の両方を含む。液体組成物としては、液剤（乳剤を含む）、懸濁液、エマルジョン（マイクロエマルジョン、水中油型エマルジョン、フロアブル製剤および／またはサスポエマルジョン製剤を含む）などが挙げられ、これらは、場合により、増粘してゲルとすることが可能である。水性液体組成物の一般的なタイプは、液剤、ＳＣ剤、カプセル懸濁液、濃縮エマルジョン、マイクロエマルジョン、水中油型エマルジョン、フロアブル製剤およびサスポエマルジョン製剤である。非水性液体組成物の一般的なタイプは、乳剤、マイクロ乳剤、分散性濃縮物および油分散液である。

10

【 0 2 4 0 】

固体組成物の一般的なタイプは、粉剤、粉末、粒剤、ペレット、ブリル、パスタイル、錠剤、充填フィルム（種子粉衣を含む）等であり、これらは水分散性（「水和性」）または水溶性とすることができる。フィルム形成溶液または流動性懸濁液から形成されたフィルムおよびコーティングは、種子処理に特に有用である。有効成分は（マイクロ）カプセル化することができ、更に懸濁液または固体製剤に形成することができる：あるいは、有効成分の全製剤をカプセル化（または「オーバーコート」）することができる。カプセル化により、有効成分の放出の制御または遅延が可能である。乳化性粒剤は、乳剤製剤と乾燥粒状製剤の両方の利点を兼ね備える。更なる製剤の中間体として、主として高強度組成物が使用される。

20

【 0 2 4 1 】

噴霧可能な製剤は、典型的には、噴霧前に適切な媒体で希釈される。このような液体および固体製剤は、通常は水であるが、場合によっては芳香族もしくはパラフィン系炭化水素または植物油のような別の適切な媒体である噴霧媒体で容易に希釈されるよう配合される。噴霧量は、ヘクタール当たり約１～数千リットルの範囲とすることができるが、より典型的には、ヘクタール当たり約１０～数百リットルの範囲である。噴霧可能な製剤は、空中もしくは地上での施用による葉の処理のために、または、植物の成長培地への施用のために水または別の適切な媒体と、タンク内で混合することが可能である。液体および乾燥製剤は、点滴かんがいシステムに直接計量投入したり、植え付けの最中に畝間に計量投入したりできる。

30

【 0 2 4 2 】

製剤は、典型的には、合計で１００重量％となる以下の適切な範囲内で、有効量の有効成分、希釈剤および界面活性剤を含有する。

【 0 2 4 3 】

40

50

【表 8】

	重量%		
	有効成分	希釈剤	界面活性剤
顆粒水和剤および顆粒水溶剤、 錠剤ならびに粉末	0.001-90	0-99.999	0-15
油分散液、懸濁液、エマルション、 液剤(乳剤を含む)	1-50	40-99	0-50
粉剤	1-25	70-99	0-5
粒剤およびペレット	0.001-99	5-99.999	0-15
高強度組成物	90-99	0-10	0-2

10

【0244】

固体希釈剤には、例えば、ベントナイト、モンモリロナイト、アタパルジャイトおよびカオリンのような粘土、セッコウ、セルロース、二酸化チタン、酸化亜鉛、デンプン、デキストリン、糖類（例えば、ラクトース、スクロース）、シリカ、タルク、マイカ、ケイ藻土、尿素、炭酸カルシウム、炭酸ナトリウムおよび重炭酸ナトリウム、ならびに硫酸ナトリウムが含まれる。典型的な固体希釈剤は、Watkinsら、Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers、第2版、Dorland Books、Caldwell、New Jerseyに記載されている。

20

【0245】

液体希釈剤としては、例えば、水、N,N-ジメチルアルカンアミド（例えば、N,N-ジメチルホルムアミド）、リモネン、ジメチルスルホキシド、N-アルキルピロリドン（例えば、N-メチルピロリジノン）、リン酸アルキル（例えば、リン酸トリエチル）、エチレングリコール、トリエチレングリコール、プロピレングリコール、ジプロピレングリコール、ポリプロピレングリコール、炭酸プロピレン、炭酸ブチレン、パラフィン（例えば、白色鉱油、直鎖パラフィン、イソパラフィン）、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、グリセリン、三酢酸グリセリン、ソルビトール、芳香族炭化水素、脱芳香族脂肪族化合物、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、シクロヘキサノン、2-ヘプタノン、イソホロンおよび4-ヒドロキシ-4-メチル-2-ペンタノンのようなケトン、酢酸イソアミル、酢酸ヘキシル、酢酸ヘプチル、酢酸オクチル、酢酸ノニル、酢酸トリデシルおよび酢酸イソボルニルのような酢酸エステル、アルキル化乳酸エステル、二塩基性エステル、アルキルおよびアリアル安息香酸エステルおよびγ-ブチロラク톤のような他のエステル、ならびに、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロピルアルコール、n-ブタノール、イソブチルアルコール、n-ヘキサノール、2-エチルヘキサノール、n-オクタノール、デカノール、イソデシルアルコール、イソオクタデカノール、セチルアルコール、ラウリルアルコール、トリデシルアルコール、オレイルアルコール、シクロヘキサノール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ジアセトンアルコール、クレゾールおよびベンジルアルコールのような、直鎖、分枝、飽和または不飽和であるアルコールが挙げられる。液体希釈剤としては更に、植物種子油および果実油（例えば、オリーブ油、ヒマシ油、亜麻仁油、ゴマ油、コーン油（トウモロコシ油）、落花生油、ヒマワリ油、グレープシード油、サフラワー油、綿実油、ダイズ油、ナタネ油、ココナツ油およびパーム核油）、動物由来脂肪（例えば、牛脂、豚脂、ラード、タラ肝油、魚油）ならびにそれらの混合物のような飽和および不飽和脂肪酸（典型的にはC₆~C₂₂）のグリセリン

30

40

50

エステルも挙げられる。液体希釈剤としては更に、脂肪酸が植物および動物源からのグリセリンエステルの加水分解によって得られ、蒸留によって精製可能なアルキル化脂肪酸（メチル化、エチル化、ブチル化）が挙げられる。典型的な液体希釈剤は、Marsden、Solvents Guide、第2版、Interscience、New York、1950に記載されている。

【0246】

本発明の固体および液体組成物は多くの場合、1種またはそれ以上の界面活性剤を含む。液体に添加した場合、界面活性剤（「表面活性剤」としても公知である）は一般的に、液体の表面張力を変更し、多くの場合は低下させる。界面活性剤分子中の親水性基および親油性基の性質次第で、界面活性剤は、湿潤剤、分散剤、乳化剤または消泡剤として有用となり得る。

10

【0247】

界面活性剤は、非イオン性、アニオン性またはカチオン性に分類することができる。本組成物にとって有用な非イオン性界面活性剤としては、以下が挙げられるが、これに限定されない：天然および合成アルコール（分枝または直鎖であってもよい）系であり、アルコールおよびエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはそれらの混合物から製造されるアルコールアルコキシラートなどのアルコールアルコキシラート；アミンエトキシラート、アルカノールアミドおよびエトキシ化アルカノールアミド；エトキシ化されたダイズ油、ヒマシ油およびナタネ油のようなアルコキシ化トリグリセリド；オクチルフェノールエトキシラート、ノニルフェノールエトキシラート、ジノニルフェノールエトキシラートおよびドデシルフェノールエトキシラート（フェノールおよびエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはそれらの混合物から製造される）のようなアルキルフェノールアルコキシラート；エチレンオキシドまたはプロピレンオキシドから製造されるブロックポリマーおよび末端ブロックがプロピレンオキシドから製造される逆ブロックポリマー；エトキシ化脂肪酸；エトキシ化脂肪エステルおよび油；エトキシ化メチルエステル；エトキシ化トリスチリルフェノール（エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはそれらの混合物から製造されるものを含む）；脂肪酸エステル、グリセリンエステル、ラノリン系誘導体、ポリエトキシ化ソルビタン脂肪酸エステル、ポリエトキシ化ソルビトール脂肪酸エステルおよびポリエトキシ化グリセリン脂肪酸エステルのようなポリエトキシラートエステル；ソルビタンエステルなどの他のソルビタン誘導体；ランダムコポリマー、ブロックコポリマー、アルキドペグ（ポリエチレングリコール）樹脂、グラフトまたはコムポリマーおよびスターポリマーなどの高分子界面活性剤；ポリエチレングリコール（ペグ）；ポリエチレングリコール脂肪酸エステル；シリコン系界面活性剤；ならびにスクロースエステル、アルキルポリグリコシドおよびアルキルポリサッカリドのような糖誘導体。

20

30

【0248】

有用なアニオン性界面活性剤としては、以下が挙げられるが、これに限定されない：アルキルアリアルスルホン酸およびそれらの塩；カルボキシル化アルコールまたはアルキルフェノールエトキシラート；ジフェニルスルホナート誘導体；リグニンおよびリグノスルホナートのようリグニン誘導体；マレイン酸またはコハク酸またはそれらの無水物；オレフィンスルホナート；アルコールアルコキシラートのリン酸エステル、アルキルフェノールアルコキシラートのリン酸エステルおよびスチリルフェノールエトキシラートのリン酸エステルのようなリン酸エステル；タンパク質系界面活性剤；サルコシン誘導体；スチリルフェノールエーテルスルファート；油および脂肪酸のスルファートおよびスルホナート；エトキシ化アルキルフェノールのスルファートおよびスルホナート；アルコールのスルファート；エトキシ化アルコールのスルファート；N,N-アルキルタウラートのようなアミンおよびアミドのスルホナート；ベンゼン、クメン、トルエン、キシレン、ならびにドデシルおよびトリデシルベンゼンのスルホナート；縮合ナフタレンのスルホナート；ナフタレンおよびアルキルナフタレンのスルホナート；分留された石油のスルホナート；スルホスクシナート；ならびにジアルキルスルホスクシナート塩のようなスルホスク

40

50

シナートおよびそれらの誘導体。

【0249】

有用なカチオン性界面活性剤としては、以下が挙げられるが、これに限定されない：アミドおよびエトキシル化アミド；N - アルキルプロパンジアミン、トリプロピレントリアミンおよびジプロピレンテトラミン、ならびにエトキシル化アミン、エトキシル化ジアミンおよびプロボキシル化アミン（アミンおよびエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはそれらの混合物から製造される）のようなアミン；酢酸アミンのようなアミン塩およびジアミン塩；第四級塩、エトキシル化第四級塩およびジ第四級塩のような第四級アンモニウム塩；ならびにアルキルジメチルアミンオキシドおよびビス - （2 - ヒドロキシエチル） - アルキルアミンオキシドのようなアミンオキシド。

10

【0250】

非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物、または非イオン性界面活性剤とカチオン性界面活性剤との混合物も、本組成物には有用である。非イオン性、アニオン性およびカチオン性界面活性剤ならびにそれらの推奨される使用については、McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, annual American and International Editions, McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 刊行；SiselyおよびWood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964；ならびに、A. S. DavidsonおよびB. Milwidsky, Synthetic Detergents, 第7版, John Wiley and Sons, New York, 1987を含む様々な公表された文献に開示されている。

20

【0251】

本発明の組成物は、配合補助剤として当業者に公知である配合助剤および添加剤を更に含有してもよい（これらの一部は、固体希釈剤、液体希釈剤または界面活性剤としても機能すると考えられる）。このような配合助剤および添加剤は、以下を制御し得る：pH（緩衝液）、加工中の発泡（ポリオルガノシロキサンのような消泡剤）、有効成分の沈降（懸濁剤）、粘度（チキソトロピー増粘剤）、容器内微生物の成長（抗菌薬）、生成物の凍結（凍結防止剤）、色（染料／顔料分散剤）、洗い流し（フィルム形成剤または粘着剤）、蒸発（蒸発遅延剤）、および他の製剤属性。フィルム形成剤としては、例えば、ポリ酢酸ビニル、ポリ酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルピロリドン - 酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルアルコール、ポリビニルアルコールコポリマーおよびワックスが挙げられる。配合助剤および添加剤の例としては、McCutcheon's 第2巻：Functional Materials, annual International and North American editions, McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 刊行；およびPCT公開WO 03 / 024222に列挙されるものが挙げられる。

30

【0252】

式1の化合物および他のいずれかの有効成分は、典型的には、有効成分を溶媒に溶解させることにより、または、液体または乾燥希釈剤中で磨砕することにより、本組成物に組み込まれる。乳剤を含む液剤は、原材料を単純に混合することにより製造することができる。乳剤としての使用が意図される液体組成物の溶媒が非水混和性である場合、乳化剤が、典型的には水での希釈時に活性含有溶媒を乳化するために添加される。2,000 μmまでの粒径を有する有効成分スラリーは、媒体ミルを使用して湿式粉碎し、平均径が3 μm未満の粒子を得ることができる。水性スラリーを最終SC剤へと加工することができ（例えば、U.S. 3,060,084を参照されたい）、または噴霧乾燥によって更に処理して顆粒水和剤を形成することができる。乾燥製剤は、通常、乾式粉碎プロセスを必要とし、それにより2 ~ 10 μm範囲の平均粒径がもたらされる。粉剤および粉末は、プレ

40

50

ンドし、通常は磨砕（ハンマーミルまたは流体エネルギーミルなどで）することにより、製造することができる。粒剤およびペレットは、予備形成された顆粒担体上に活性材料を噴霧することにより、または凝集技法によって製造することができる。Browning、「Agglomeration」、Chemical Engineering、1967年12月4日、147～48頁、Perry's Chemical Engineer's Handbook、第4版、McGraw-Hill、New York、1963、8～57頁以降、およびWO91/13546を参照されたい。ペレットは、U.S. 4,172,714に記載されているようにして製造することができる。顆粒水和剤および顆粒水溶剤は、U.S. 4,144,050、U.S. 3,920,442およびDE 3,246,493に教示されるようにして製造することができる。錠剤は、U.S. 5,180,587、U.S. 5,232,701およびU.S. 5,208,030に教示されるように製造することができる。フィルムは、GB 2,095,558およびU.S. 3,299,566に教示されるように製造することができる。

10

【0253】

製剤技術に関する更なる情報に関しては、T.S. Woods、「The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture」 in Pesticide Chemistry and Bioscience、The Food-Environment Challenge、T. BrooksおよびT.R. Roberts編、Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry、The Royal Society of Chemistry、Cambridge、1999、120～133頁を参照されたい。更に、U.S. 3,235,361、6欄16行～7欄19行および実施例10～41；U.S. 3,309,192、5欄43行～7欄62行ならびに実施例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138～140、162～164、166、167および169～182；U.S. 2,891,855、3欄66行～5欄17行および実施例1～4；Klingman、Weed Control as a Science、John Wiley and Sons, Inc.、New York、1961、81～96頁；Hanceら、Weed Control Handbook、第8版、Blackwell Scientific Publications、Oxford、1989；およびDevelopments in Formulation Technology、PJB Publications、Richmond、UK、2000を参照されたい。

20

30

【0254】

以下の実施例において、パーセンテージは全て重量基準であり、製剤は全て従来法で製造される。化合物番号は、索引表Aにおける化合物を指す。更なる詳細がなくても、先行する記載を使用する当業者は、本発明を最大限に利用可能であると考えられる。したがって、以下の実施例は、単なる例示に過ぎず、決して本開示を限定するものではないと解釈すべきである。別途記載されていない限り、パーセンテージは重量基準である。

【0255】

【表9】

40

実施例 A

高強度濃縮物

化合物1	98.5%
シリカエアロゲル	0.5%
合成非晶質微細シリカ	1.0%

【0256】

50

【表 1 0】

実施例 B水和剤

化合物 1	65.0%	
ドデシルフェノールポリエチレングリコールエーテル	2.0%	
リグニンスルホン酸ナトリウム	4.0%	
アルミノケイ酸ナトリウム	6.0%	
モンモリロナイト(か焼)	23.0%	10

【 0 2 5 7】

【表 1 1】

実施例 C粒剤

化合物 1	10.0%	
アタパルジャイト顆粒(低揮発性物質、 0.71/0.30mm;U.S.S.No.25-50 篩)	90.0%	20

【 0 2 5 8】

【表 1 2】

実施例 D押出ペレット

化合物 1	25.0%	
無水硫酸ナトリウム	10.0%	30
粗リグニンスルホン酸カルシウム	5.0%	
アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム	1.0%	
カルシウム/マグネシウムベントナイト	59.0%	

【 0 2 5 9】

【表 1 3】

実施例 E乳剤

化合物 1	10.0%	
ヘキサオレイン酸ポリオキシエチレンソルビトール	20.0%	
C ₆ ~C ₁₀ 脂肪酸メチルエステル	70.0%	

【 0 2 6 0】

【表 1 4】

実施例 Fマイクロエマルジョン

化合物 1	5.0%	
ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー	30.0%	
アルキルポリグリコシド	30.0%	
モノオレイン酸グリセリル	15.0%	
水	20.0%	10

【 0 2 6 1】

【表 1 5】

実施例 GSC 剤

化合物 1	35%	
ブチルポリオキシエチレン/ポリプロピレンブロック コポリマー	4.0%	20
ステアリン酸/ポリエチレングリコールコポリマー	1.0%	
スチレンアクリルポリマー	1.0%	
キサントガム	0.1%	
プロピレングリコール	5.0%	
シリコーン系消泡剤	0.1%	
1,2-ベンゾイソチアゾリン-3-オン	0.1%	
水	53.7%	30

【 0 2 6 2】

【表 1 6】

実施例 H水中エマルジョン

化合物 1	10.0%	
ブチルポリオキシエチレン/ポリプロピレンブロック	4.0%	
コポリマー		
ステアリン酸/ポリエチレングリコールコポリマー	1.0%	
スチレンアクリルポリマー	1.0%	10
キサントガム	0.1%	
プロピレングリコール	5.0%	
シリコーン系消泡剤	0.1%	
1,2-ベンゾイソチアゾリン-3-オン	0.1%	
芳香族石油系炭化水素	20.0	
水	58.7%	

【0 2 6 3】

20

【表 1 7】

実施例 I油分散液

化合物 1	25%	
ヘキサオレイン酸ポリオキシエチレンソルビトール	15%	
有機修飾ベントナイト粘土	2.5%	
脂肪酸メチルエステル	57.5%	30

【0 2 6 4】

本開示は、上記「化合物 1」を「化合物 2」および「化合物 3」、「化合物 4」、「化合物 5」、「化合物 6」、「化合物 7」、「化合物 8」、または「化合物 9」に置き換えたことを除き、上記実施例 A ~ I を更に含む。試験結果は、本発明の化合物が、活性が高度な発生前処理除草剤および/または発生後処理除草剤および/または植物成長調節剤であることを示している。本発明の化合物は一般的に、発生後雑草防除（即ち、土壌から雑草の実生が出現した後に施用）および発生前雑草防除（即ち、土壌から雑草の実生が出現する前に施用）の場合に最も高い活性を示す。その多くは、燃料保管タンクの周囲、産業用保管領域、駐車場、ドライブインシアター、飛行場、河岸、灌漑用および他の水路、広

告板の周囲、ならびに、幹線道路および鉄道構造物のような、全ての植生の完全な防除が望まれる領域における広範囲の発生前および/または発生後雑草防除について実用性を有する。本発明の化合物の多くは、農作物対雑草における選択的な代謝のため、または、農作物および雑草における生理的阻害位置における選択的な活性により、または、農作物と雑草の混合物の環境上または内の選択的な配置により、農作物/雑草混合物中における草および広葉雑草の選択的な防除に有用である。当業者であれば認識することであるが、化合物または化合物群におけるこれらの選択性要因の好適な組合せは、慣例的な生物学的および/または生化学的アッセイを実施することにより容易に判定可能である。本発明の化合物は、アルファルファ、オオムギ、ワタ、コムギ、セイヨウアブラナ、サトウダイコン、コーン（トウモロコシ）、ソルガム、ダイズ、イネ、オートムギ、ピーナッツ、野菜、

40

50

トマト、ジャガイモ、コーヒー、カカオ、アブラヤシ、ゴム、サトウキビ、柑橘類、ブドウ、果樹、堅果樹、バナナ、プランテン、パイナップル、ホップ、茶を含む多年生プランテーション農作物、ならびにユーカリおよび針葉樹（例えば、テダマツ）のような森林、および芝生種（例えば、ケンタッキーブルーグラス、アメリカシバ、ケンタッキーフェスキューおよびギョウギシバ）を含むが、これに限定されない重要な普通農作物に対して耐性を示し得る。本発明の化合物は、遺伝子組換えまたは交配により除草剤に対する耐性が組み込まれ、無脊椎動物有害生物に対して毒性のあるタンパク質（バチルス・チューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）毒素など）を発現し、および/または、他の有用な形質を発現する農作物に用いることが可能である。当業者であれば理解することであるが、当業者は、全ての化合物が全ての雑草に対して等しく効果的であるわけではない。代わりに、本化合物は、植物の成長を改変するのに有用である。

10

【0265】

本発明の化合物は、発生前処理除草および発生後処理除草の両方の活性を有しているため、植生を死滅させる、または植生に損傷を与える、または、その成長を抑制することにより望ましくない植生を防除するには、化合物を、本発明の化合物または前記化合物と界面活性剤、固体希釈剤もしくは液体希釈剤のうちの少なくとも1種を含む組成物の除草有効量を、望ましくない植生の群葉もしくは他の部分に、または、望ましくない植生が成長している土壌もしくは水、または望ましくない植生の種子もしくは他の珠芽の周囲の土壌もしくは水のような望ましくない植生の環境に接触させることを含む多様な方法により有用に施用することができる。望ましくない植生には、草雑草および広葉雑草からなる群から選択される少なくとも1種が含まれる。望ましくない植生は、スズメノカタビラ、マルバツユクサ、ブラックグラス、イヌホオズキ、メリケンクキビ、セイヨウトゲアザミ、カラスノチャヒキ、オナモミ（キサランチウム・ペンシルバニウム（*Xanthium pensylvanicum*））、ブタクサ、ヒナゲシ、マキバスマレ、アキノエノコログサ、オヒシバ、エノコログサ、ギニアキビ、コセンダングサ、除草剤抵抗性ブラックグラス、ヒメムカシヨモギ、イタリアンライグラス、ヨウシュチョウセンアサガオ、セイバンモロコシ（ソルガム・ハレペンス（*Sorghum halepense*））、オニメヒシバ、リトルシードカナリーグラス、アサガオ、ペンシルバニアスマートウィード、ヒラミホシアサガオ、ブリクリシダ、シバムギ、アオビユ、シャッターケイン、ナズナ、シルキーウィンドグラス、ヒマワリ（ジャガイモ栽培の雑草としての）、ソバカズラ（ポリゴナム・コンボルブルス（*Polygonum convolvulus*））、ノハラガラシ（ブラシカ・カバー（*Brassica kaber*））、カラスムギ（アベナ・ファツア（*Avena fatua*））、ショウジョウソウ、キンエノコロ、およびショクヨウガヤツリ（シペラス・エスクレンタス（*Cyperus esculentus*））からなる群から選択される。

20

30

【0266】

本発明の化合物の除草有効量は、多数の要因によって判定される。これらの要因としては、選択した製剤、施用方法、存在する植生の量およびタイプ、成長条件等が挙げられる。通例では、本発明の化合物の除草有効量は、約0.001~20kg/haであり、約0.004~1kg/haが好適な範囲である。当業者は、所望される雑草防除レベルに必要な除草有効量を容易に判定可能である。

40

【0267】

一般的な一実施形態において、本発明の化合物は、典型的には組成物に配合され、所望の植生（例えば農作物）および望ましくない植生（即ち、雑草）（これらは共に、種子、実生および/またはより成長した植物の場合がある）を含む生息地に対し、成長培地（例えば土壌）に接触させて施用される。この生息地において、本発明の化合物を含む組成物は、特に望ましくない植生の植物もしくはその一部に対し、および/または、植物に接触している成長培地に対し、直接施用することが可能である。

【0268】

本発明の化合物で処理された生息地における所望の植生の植物の変種および栽培変種は

50

、従来の繁殖および交配方法により、または、遺伝子操作法により得ることが可能である。遺伝子操作された植物（遺伝子組換え植物）は、異種遺伝子（導入遺伝子）が植物のゲノムに安定的に組み込まれたものである。植物ゲノムにおける特定の位置により定義される導入遺伝子は、形質転換または遺伝子組換えイベントと呼ばれる。

【0269】

本発明に従い処理可能な生息地における遺伝子操作された植物栽培変種は、1つまたはそれ以上の生物ストレス（線虫、昆虫、ダニ、菌類などのような有害生物）もしくは非生物ストレス（渇水、低温、土壌塩分など）に対して耐性があるもの、または他の望ましい特性を含有するものを含む。植物は、遺伝子操作されて、例えば、除草剤耐性、虫害抵抗性、変性油プロファイルまたは渇水耐性といった形質を示すことが可能である。

10

【0270】

最も典型的には、本発明の化合物は望ましくない植生の防除に用いられるが、処理された生息地における所望の植生に本発明の化合物を接触させることで、遺伝子組換えを介して組み込まれた形質を含む、所望の植生における遺伝形質と、超相加的または相乗的な（強化された）効果がもたらされることがある。例えば、植食性害虫もしくは植物病害に対する抵抗性、生物/非生物ストレスに対する耐性、または、貯蔵安定性が、所望の植生における遺伝形質から予想されるものより大きくなる場合がある。

【0271】

本発明の化合物は更に、除草剤、除草剤薬害軽減剤、殺真菌剤、殺虫剤、抗線虫剤、殺菌剤、殺ダニ剤、昆虫脱皮阻害剤および発根刺激剤のような成長調節剤、不妊化剤、信号化学物質、忌避剤、誘引剤、フェロモン、摂食刺激物質、植物栄養素、他の生物学的活性化合物、または昆虫病原性バクテリア、ウイルスまたは菌類を含む1種またはそれ以上の他の生物学的活性化合物または活性剤と混合することにより多成分型農薬を形成して、農業的保護範囲を更に拡大させることが可能である。本発明の化合物と他の除草剤との混合物は、追加の雑草種に対する活性範囲を拡大し、任意の抵抗性バイオタイプの増殖を抑制することが可能である。したがって、本発明は更に、式1の化合物（除草有効量で）と、少なくとも1種の追加の生物学的活性化合物または活性剤（生物学的に有効な量で）とを含む組成物に関し、界面活性剤、固体希釈剤または液体希釈剤の少なくとも1種を更に含むことが可能である。他の生物学的活性化合物または活性剤を、界面活性剤、固体または液体希釈剤の少なくとも1種を含む組成物に配合することも可能である。本発明の混合物について、1種またはそれ以上の他の生物学的活性化合物もしくは活性剤を式1の化合物と共に配合して予混合物を形成したり、1種またはそれ以上の他の生物学的活性化合物もしくは活性剤を式1の化合物とは別に配合し、製剤を施用前に（例えば、噴霧タンク中で）混ぜ合わせるか、もしくは、交互に連続して施用したりすることが可能である。

20

30

【0272】

以下の除草剤の1種またはそれ以上と本発明の化合物との混合物が、雑草防除に特に有用となり得る：アセトクロール、アシフルオルフェンおよびそのナトリウム塩、アクロニフェン、アクロレイン（2-プロペナール）、アラクロール、アロキシジム、アメトリン、アミカルバゾン、アミドスルフロン、アミノシクロピラクロールおよびそのエステル（例えば、メチル、エチル）および塩（例えば、ナトリウム、カリウム）、アミノピラリド、アミトロール、スルファミン酸アンモニウム、アニロホス、アシュラム、アトラジン、アジメスルフロン、ベフルブタミド、S-ベフルブタミド、ベナゾリン、ベナゾリン-エチル、ベンカルバゾン、ベンフルラリン、ベンフレセート、ベンスルフロン-メチル、ベンスリド、ベントゾン、ベンゾピシクロン、ベンゾフェナップ、ピシクロピロン、ピフェノックス、ピラナホス、ビスピリバックおよびそのナトリウム塩、プロマシル、プロモブチド、プロモフェノキシム、プロモキシニル、オクタン酸プロモキシニル、ブタクロール、ブタフェナシル、ブタミホス、ブトラリン、ブトロキシジム、ブチレート、カフェンストロール、カルベタミド、カルフェントラゾン-エチル、カテキン、クロメトキシフェン、クロラムベン、クロルプロムロン、クロルフルレノール-メチル、クロリダゾン、クロリムロン-エチル、クロロトルロン、クロルプロファム、クロルスルフロン、クロルタール

40

50

- ジメチル、クロルチアミド、シニドン - エチル、シンメシリン、シノスルフロ、クラシホス、クレホキシジム、クレトジム、クロジナホップ - プロパルギル、クロマゾン、クロメプロップ、クロピラリド、クロピラリド - オラミン、クロランスラム - メチル、クミルロン、シアナジン、シクロエート、シクロピラニル、シクロピリモレート、シクロスルファミロン、シクロキシジム、シハロホップ - ブチル、2, 4 - D およびそのブトチル、ブチル、イソオクチルおよびイソプロピルエステルおよびそのジメチルアンモニウム、ジオラミンおよびトロラミン塩、ダイムロン、ダラボン、ダラボン - ナトリウム、ダゾメット、2, 4 - DB およびそのジメチルアンモニウム、カリウムおよびナトリウム塩、デスメディファミン、デスメトリン、ジカンバおよびそのジグリコールアンモニウム、ジメチルアンモニウム、カリウムおよびナトリウム塩、ジクロベニル、ジクロルプロップ、ジクロホップ - メチル、ジクロスラム、メチル硫酸ジフェンゾコート、ジフルフェニカン、ジフルフェンゾピル、ジメフロ、ジメピペレート、ジメタクロール、ジメタメトリン、ジメテナミド、ジメテナミド - P、ジメチピン、ジメチルアルシン酸およびそのナトリウム塩、ジニトロアミン、ジノテルブ、ジフェナミド、ジクワットジプロミド、ジチオピル、ジウロン、DNOC、エンドタール、EPTC、エスプロカルブ、エタルフルラリン、エタメツルフロ - メチル、エチオジン、エトフメセート、エトキシフェン、エトキシスルフロ、エトベンザニド、フェノキサプロップ - エチル、フェノキサプロップ - P - エチル、フェノキサスルホン、フェンキノトリオン、フェントラザミド、フェヌロン、フェヌロン - TCA、フラムプロップ - メチル、フラムプロップ - M - イソプロピル、フラムプロップ - M - メチル、フラザスルフロ、フロラスラム、フルアジホップ - ブチル、フルアジホップ - P - ブチル、フルアゾレート、フルカルバゾン、フルセトスルフロ、フルクロラリン、フルフェナセット、フルフェンピル、フルフェンピル - エチル、フルメツラム、フルミクロラック - ペンチル、フルミオキサジン、フルオメツロン、フルオログリコフェン - エチル、フルポキサム、フルピルスルフロ - メチルおよびそのナトリウム塩、フルレノール、フルレノール - ブチル、フルリドン、フルロクロリドン、フルロキシピル、フルルタモン、フルチアセット - メチル、フォメサフェン、ホラムスルフロ、ホサミン - アンモニウム、グルホシネート、グルホシネート - アンモニウム、グルホシネート - P、アンモニウム、イソプロピルアンモニウム、カリウム、ナトリウム（セスキナトリウムを含む）およびトリメシウム（代替的にスルホサートとも呼ばれる）のような、グリホサートおよびその塩、ハラウキシフェン、ハラウキシフェン - メチル、ハロスルフロ - メチル、ハロキシホップ - エチル、ハロキシホップ - メチル、ヘキサジノン、ヒダントシジン、イマザメタベンズ - メチル、イマザモックス、イマザピク、イマザピル、イマザキン、イマザキン - アンモニウム、イマゼタピル、イマゼタピル - アンモニウム、イマゾスルフロ、インダノファン、インダジフラム、イオフェンスルフロ、ヨードスルフロ - メチル、アイオキシニル、オクタン酸アイオキシニル、アイオキシニル - ナトリウム、イプフェンカルバゾン、イソプロツロン、イソウロン、イソキサベン、イソキサフルトール、イソキサクロルトール、ラクトフェン、レナシル、リニユロン、マレイン酸ヒドラジド、MCPA およびその塩（例えば、MCPA - ジメチルアンモニウム、MCPA - カリウムおよび MCPA - ナトリウム、エステル（例えば、MCPA - 2 - エチルヘキシル、MCPA - ブトチル）およびチオエステル（例えば、MCPA - チオエチル）、MCPB およびその塩（例えば、MCPB - ナトリウム）およびエステル（例えば、MCPB - エチル）、メコプロップ、メコプロップ - P、メフェンアセト、メフルイジド、メソスルフロ - メチル、メソトリオン、メタム - ナトリウム、メタミホップ、メタミトロン、メタザクロル、メタゾスルフロ、メタベンズチアズロン、メチルアルソン酸およびそのカルシウム、一アンモニウム、一ナトリウムおよび二ナトリウム塩、メチルジムロン、メトベンズロン、メトプロムロン、メトラクロル、S - メトラクロル、メトスラム、メトキスロン、メトリブジン、メトスルフロ - メチル、モリネート、モノリヌロン、ナプロアニリド、ナプロップアミド、ナプロップアミド - M、ナプタラム、ネブロン、ニコスルフロ、ノルフルラゾン、オルベンカルブ、オルトスルファミロン、オリザリン、オキサジアリル、オキサジアゾン、オキサスルフロ、オキサジクロメホン、オキシフルオルフェン

10

20

30

40

50

、パラコートジクロリド、ペブレート、ペラルゴン酸、ペンジメタリン、ペノキスラム、ペンタノクロル、ペントキサゾン、ペルフルイドン、ペトキサミド、ペトキシアミド、フェンメジファミン、ピクロラム、ピクロラム - カリウム、ピコリナフェン、ピノキサデン、ピペロホース、プレチラクロル、プリミスルフロ - メチル、プロジアミン、プロホキシジウム、プロメトン、プロメトリン、プロバクロル、プロパニル、プロパキザホップ、プロパジン、プロファミン、プロピソクロル、プロボキシカルバゾン、プロピリスルフロ - プロピズアミド、プロスルホカルブ、プロスルフロ - ピラクロニル、ピラフルフェン - エチル、ピラスルホトール、ピラゾギル、ピラゾリネート、ピラゾキシフェン、ピラゾスルフロ - エチル、ピリベンゾオキシム、ピリブチカルブ、ピリデート、ピリフタリド、ピリミノバク - メチル、ピリミスルファン、ピリチオバク、ピリチオバク - ナトリウム、ピロキサスルホン、ピロキシスラム、キンクロラク、キンメラク、キノクラミン、キザロホップ - エチル、キザロホップ - P - エチル、キザロホップ - P - テフリル、リムスルフロ - サフルフェナシル、セトキシジウム、シズロン、シマジン、シメトリン、スルコトリオン、スルフェントラゾン、スルホメツロン - メチル、スルホスルフロ - 2, 3, 6 - TBA, TCA, TCA - ナトリウム、トブタム、トブチウロン、テフリルトリオン、テンボトリオン、テブラロキシジウム、テルバシル、テルブメトン、テルブチルアジン、テルブトリン、テニルクロル、チアゾピル、チエンカルバゾン、チフェンスルフロ - メチル、チオベンカルブ、チアフェナシル、チオカルバジル、トルピラレート、トブラメゾン、トラルコキシジウム、トリ - アレート、トリアファモン、トリアスルフロ - トリアジフラム、トリベヌロン - メチル、トリクロピル、トリクロピル - ブトチル、トリクロピル - トリエチルアンモニウム、トリジファン、トリエタジン、トリフロキシスルフロ - トリフルジモキサジン、トリフルラリン、トリフルスルフロ - メチル、トリトスルフロ - ベルノレート、3 - (2 - クロロ - 3, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 1, 5 - ナフチリジン - 2 (1H) - オン、5 - クロロ - 3 - [(2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル)カルボニル] - 1 - (4 - メトキシフェニル) - 2 (1H) - キノキサリノン、2 - クロロ - N - (1 - メチル - 1H - テトラゾール - 5 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジンカルボキサミド、7 - (3, 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 5 - (2, 2 - ジフルオロエチル) - 8 - ヒドロキシピリド [2, 3 - b] ピラジン - 6 (5H) - オン、4 - (2, 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6 - ジメチル - 3 (2H) - ピリダジノン、5 - [[(2, 6 - ジフルオロフェニル)メトキシ]メチル] - 4, 5 - ジヒドロ - 5 - メチル - 3 - (3 - メチル - 2 - チエニル)イソオキサゾール (以前はメチオキシリオン)、4 - (4 - フルオロフェニル) - 6 - [(2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル)カルボニル] - 2 - メチル - 1, 2, 4 - トリアジン - 3, 5 (2H, 4H) - ジオン、メチル 4 - アミノ - 3 - クロロ - 6 - (4 - クロロ - 2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) - 5 - フルオロ - 2 - ピリジンカルボキシレート、2 - メチル - 3 - (メチルスルホニル) - N - (1 - メチル - 1H - テトラゾール - 5 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル)ベンズアミドおよび 2 - メチル - N - (4 - メチル - 1, 2, 5 - オキサジアゾール - 3 - イル) - 3 - (メチルスルフィニル) - 4 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド。その他の除草剤としては、アルテルナリア・デストルエンシ・シモンズ (*Alternaria destruens* Simmons)、コレトリカム・グロエオスポリオドズ (*Colletotrichum gloeosporioides*) (Penz.) Penz. & Sacc., ドレシユイエラ・モノセラ (*Drechslera monoceras*) (MTB - 951)、ミロテシウム・ベルカリヤ (*Myrothecium verrucaria*) (Albertini & Schweinitz) Ditmar: Fries、フィトフトラ・パルミボラ (*Phytophthora palmivora*) (Butl.) Butl. およびプッシニア・テラスペオス (*Puccinia thlaspeos* Schub) などの生物除草剤も挙げられる。

【0273】

望ましくない植生のより良好な防除 (例えば、相加的を超える効果、防除される雑草の

10

20

30

40

50

範囲の拡大、または、農作物の安全性の強化などによる使用量の低減)のために、または抵抗性雑草の発生を防止するために、本発明の化合物と、アトラジン、アジメスルフロン、ベフルブトアミド、S - ベフルブトアミドF 4 0 5 0、ベンゾイソチアゾリノン、カルフェントラゾン - エチル、クロリムロン - エチル、クロルスルフロン - メチル、クロマゾン、クロピラリドカリウム、クロランスラム - メチル、2 - [(2, 5 - ジクロロフェニル)メチル] - 4, 4 - ジメチル - 3 - イソオキサゾリジノンF 9 6 0 0、エタメトスルフロン - メチル、フルメツラム、4 - (4 - フルオロフェニル) - 6 - [(2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル)カルボニル] - 2 - メチル - 1, 2, 4 - トリアジン - 3, 5 - (2 H, 4 H) - ジオンF 9 9 6 0、フルピルスルフロン - メチル、フルチアセト - メチル、ホメサフェン、イマゼタピル、レナシル、メソトリオン、メトリブジン、メトスルフロン - メチル、ペトキサミド、ピクロラム、ピロキサスルホン、キンクロラク、リムスルフロン、S - メトラクロル、スルフェントラゾン、チフェンスルフロン - メチル、トリフルスルフロン - メチル、およびトリベヌロン - メチルからなる群から選択される除草剤との混合物が好適である。

【0274】

本発明の化合物は更に、アビグリシン、N - (フェニルメチル) - 1 H - プリン - 6 - アミン、エボコレオン、ジベレリン酸、ジベレリンA₄およびA₇、ハルピンタンパク質、メピコートクロリド、プロヘキサジオンカルシウム、プロヒドロジャスモン、ナトリウムニトロフェノラートおよびトリネキサパック - メチル、ならびに、バチルス・セレウス (*Bacillus cereus*) 菌株BP01のような植物の成長を改変する生体などの植物成長調節剤と組み合わせて用いることが可能である。

【0275】

農業用保護剤(即ち、除草剤、除草剤薬害軽減剤、殺虫剤、殺菌剤、殺線虫剤、殺ダニ剤および生物剤)に関する一般的な参考文献としては、The Pesticide Manual、第13版、C. D. S. Tomlin編、British Crop Protection Council、Farnham, Surrey, U. K.、2003およびThe BioPesticide Manual、第2版、L. G. Copping編、British Crop Protection Council、Farnham, Surrey, U. K.、2001が挙げられる。

【0276】

これらの様々な混合パートナーの1種またはそれ以上が用いられる実施形態について、混合パートナーは、典型的には、混合物パートナーが単独で使用される場合に慣例となっている量と同様の量で使用される。より詳細には、混合物において、有効成分は多くの場合、製品のラベルに有効成分を単独で用いる場合に指定されている施用量の半分から全量の施用量で施用される。これらの量は、The Pesticide Manual、および、The BioPesticide Manualなどの参考文献に列挙されている。式1の化合物に対するこれらの様々な混合パートナー(合計)の重量比は、典型的には、約1:3000と約3000:1の間である。注目すべきは、約1:300と約300:1の間の重量比(例えば、約1:30と約30:1の間の比)である。当業者は、所望の範囲の生物学的活性に必要な有効成分の生物学的有効量を単純な実験を通して容易に判定することが可能である。これらの追加の成分を包含することで、防除される雑草の範囲を、式1の化合物単独で防除される範囲を超えて拡大し得ることが明らかである。

【0277】

場合によっては、本発明の化合物と他の生物学的活性(特に除草性)化合物または活性剤(即ち、有効成分)との組合せは、雑草に対して相加的を超える(即ち、相乗的(強化された))効果をもたらす、および/または、農作物または他の望ましい植物に対して拮抗作用(即ち、毒性緩和)をもたらすことが可能である。効果的な有害生物の防除を確保しつつ、環境中に放出される有効成分の量を低減させることが常に望ましい。より多くの量の有効成分を用いて、過剰な農作物被害を伴うことなくより効果的な雑草防除をもたらす能力も同様に望ましい。雑草に対する除草用有効成分の相乗作用(強化された効果)が

農学的に十分なレベルの雑草防除をもたらす施用量で生じる場合、このような組合せは、農作物生産コストの削減および環境負荷の低減に有利となり得る。除草用有効成分の毒性緩和が農作物に生じる場合、このような組合せは、雑草との競合を低減させることによる農作物保護の強化に有利となり得る。

【 0 2 7 8 】

注目すべきは、本発明の化合物と少なくとも 1 種の他の除草用有効成分との組合せである。特に注目すべきは、他の除草用有効成分が本発明の化合物とは異なる作用部位を有するような組合せである。場合によっては、同様の防除範囲を有するが作用部位が異なる少なくとも 1 種の他の除草用有効成分との組合せが、耐性管理に関して特に有利となる。したがって、本発明の組成物は、同様の防除範囲を有するが作用部位が異なる少なくとも 1 種の追加の除草用有効成分を（除草有効量で）更に含むことが可能である。

10

【 0 2 7 9 】

本発明の化合物は更に、アリドクロル、ベノキサコル、クロキントセト - メキシル、クミルウロン、シオメトリニル、シプロスルホンアミド、ダイムロン、ジクロロミド、ジシクロノナ、ジエトレート、ジメピペレート、フェンクロラゾール - エチル、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン - エチル、メフェンピル - ジエチル、メフェネート、メトキシフェノン ナフタル酸無水物（1, 8 - ナフタル酸無水物）、オキサベトリニル、N - （アミノカルボニル） - 2 - メチルベンゼンスルホンアミド、N - （アミノカルボニル） - 2 - フルオロベンゼンスルホンアミド、1 - ブロモ - 4 - [（クロロメチル）スルホニル] ベンゼン（BCS）、4 - （ジクロロアセチル） - 1 - オキサ - 4 - アゾスピロ[4.5]デカン（MON 4660）、2 - （ジクロロメチル） - 2 - メチル - 1, 3 - ジオキソラン（MG191）、エチル 1, 6 - ジヒドロ - 1 - （2 - メトキシフェニル） - 6 - オキソ - 2 - フェニル - 5 - ピリミジンカルボキシレート、2 - ヒドロキシ - N, N - ジメチル - 6 - （トリフルオロメチル）ピリジン - 3 - カルボキサミド、および 3 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル 1 - （3, 4 - ジメチルフェニル） - 1, 6 - ジヒドロ - 6 - オキソ - 2 - フェニル - 5 - ピリミジンカルボキシレート、2, 2 - ジクロロ - 1 - （2, 2, 5 - トリメチル - 3 - オキサゾリジニル） - エタノンおよび 2 - メトキシ - N - [[4 - [(メチルアミノ)カルボニル]アミノ]フェニル]スルホニル] - ベンズアミドのような除草剤薬害軽減剤と組み合わせて使用し、特定の農作物の安全性を高めることが可能である。除草剤薬害軽減剤の解毒的に有効な量は、本発明の化合物と同時に、または、種子処理として施用可能である。したがって、本発明の態様は、本発明の化合物と、解毒的に有効な量の除草剤薬害軽減剤とを含む除草用混合物に関する。解毒が物理的に農作物植物に限定されるために、種子処理が選択的な雑草防除に特に有用である。したがって、本発明の特に有用な実施形態は、農作物の生息地に除草有効量の本発明の化合物を接触させる工程を含む、農作物における望ましくない植生の成長を選択的に防除する方法であり、ここでは、農作物が成長する種子が解毒的に有効な量の薬害軽減剤で処理される。解毒的に有効な量の薬害軽減剤は、単純な実験を通じて当業者により容易に判定可能である。

20

30

【 0 2 8 0 】

本発明の化合物は更に、以下と混合することが可能である：（1）除草効果をもたらす遺伝由来の転写産物のダウンレギュレーション、干渉、抑制またはサイレンシングを通じて特定標的の量に影響を与える DNA、RNA、および / または化学的に修飾されたヌクレオチドを含むがこれに限定されないポリヌクレオチド；または（2）薬害軽減効果をもたらす遺伝由来の転写産物のダウンレギュレーション、干渉、抑制またはサイレンシングを通じて特定標的の量に影響を与える DNA、RNA、および / または化学的に修飾されたヌクレオチドを含むがこれに限定されないポリヌクレオチド。

40

【 0 2 8 1 】

注目すべきは、本発明の化合物（除草有効量で）と、他の除草剤および除草剤薬害軽減剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の追加の有効成分（有効量で）と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の成分とを含

50

む組成物である。

【 0 2 8 2 】

表 A 1 には、本発明の混合物、組成物および方法の例示である、成分 (a) と、成分 (b) の特定の組合せが列挙されている。成分 (a) 欄中の化合物 1 (即ち「 C m p d . N o . 」は「化合物番号」を表す) が索引表 A において特定されている。表 A 1 の第 2 の欄には、特定の成分 (b) 化合物 (例えば、第 1 行に「 2 , 4 - D 」) が列挙されている。表 A 1 の第 3、第 4 および第 5 欄には、圃場で栽培されている農作物に対し、成分 (b) に対して成分 (a) 化合物が典型的に施用される割合の重量比 (即ち、 (a) : (b)) の範囲が列挙されている。したがって、例えば、表 A 1 の第 1 行には、成分 (a) (即ち、索引表 A の化合物 1) と 2 , 4 - D との組合せは、典型的には、 1 : 1 9 2 と 6 : 1 の間の重量比で施用されることが具体的に開示されている。表 A 1 の残りの行も、同様に解釈すべきである。

10

【 0 2 8 3 】

20

30

40

50

【表 18】

表 A1

成分(a) (化合物番号)	成分(b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
1	2,4-D	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	アセトクロル	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
1	アシフルオルフェン	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
1	アクロニフェン	1:857-2:1	1:285-1:3	1:107-1:12
1	アラクロル	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
1	アメトリン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	アミカルバゾン	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	アミドスルフロン	1:6-168:1	1:2-56:1	1:1-11:1
1	アミノシクロピラクロル	1:48-24:1	1:16-8:1	1:6-2:1
1	アミノピラリド	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
1	アミトロール	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
1	アニロホス	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
1	アスラム	1:960-2:1	1:320-1:3	1:120-1:14
1	アトラジン	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	アジムスルフロン	1:6-168:1	1:2-56:1	1:1-11:1
1	ベフルプトアミド	1:342-4:1	1:114-2:1	1:42-1:5
1	S-ベフルプトアミド	1:171-4:0.5	1:57-2:0.5	1:21-1:2.5
1	ベンフレセート	1:617-2:1	1:205-1:2	1:77-1:9
1	ベンスルフロン-メチル	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
1	ペンタゾン	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	ベンゾビシクロン	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
1	ベンゾフェナブ	1:257-5:1	1:85-2:1	1:32-1:4
1	ビシクロピロン	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
1	ビフェノキス	1:257-5:1	1:85-2:1	1:32-1:4
1	ビスピリバク-ナトリウム	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
1	プロマシル	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	プロモブチド	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	プロモキシニル	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
1	ブタクロル	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
1	ブタフェナシル	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
1	ブチレート	1:1542-1:2	1:514-1:5	1:192-1:22
1	カルフェンストロール	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3

10

20

30

40

50

【表 19】

成分(a) (化合物番号)	成分(b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
1	カルフェントラゾン-エチル	1:128-9:1	1:42-3:1	1:16-1:2
1	クロリムロン-エチル	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
1	クロロトルロン	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
1	クロルスルフロ	1:6-168:1	1:2-56:1	1:1-11:1
1	シンコスルフロ	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	シニドン-エチル	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	シンメチリン	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
1	クラシホス	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
1	クレトジム	1:48-24:1	1:16-8:1	1:6-2:1
1	クロジナホップ-プロパルギル	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
1	クロマゾン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	クロメプロップ	1:171-7:1	1:57-3:1	1:21-1:3
1	クロピラリド	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	クロランスラム-メチル	1:12-96:1	1:4-32:1	1:1-6:1
1	クミルウロン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	シアナジン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	シクロピリモレート	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	シクロスルファミロン	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	シクロキシジム	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
1	シハロホップ	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
1	ダイムロン	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	デスメジファミ	1:322-4:1	1:107-2:1	1:40-1:5
1	ジカンバ	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	ジクロベニル	1:1371-1:2	1:457-1:4	1:171-1:20
1	ジクロルプロップ	1:925-2:1	1:308-1:3	1:115-1:13
1	ジクロホップ-メチル	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	ジクロスラム	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
1	ジフェンゾクアット	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
1	ジフルフェニカン	1:857-2:1	1:285-1:3	1:107-1:12
1	ジフルフェンゾピル	1:12-96:1	1:4-32:1	1:1-6:1
1	ジメタクロル	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
1	ジメタメトリン	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	ジメテンアミド-P	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	ジチオピル	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	ジウロン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6

10

20

30

40

50

【表 20】

成分(a) (化合物番号)	成分(b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
1	EPTC	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
1	エスプロカルブ	1:1371-1:2	1:457-1:4	1:171-1:20
1	エタルフルラリン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	エタメトスルフロソ-メチル	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	エトキシフェン	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
1	エトキシスルフロソ	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
1	エトベンザニド	1:257-5:1	1:85-2:1	1:32-1:4
1	フェノキサプロップ-エチル	1:120-10:1	1:40-4:1	1:15-1:2
1	フェノキサスルホン	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
1	フェンキノトリオン	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	フェントラズアミド	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	フラザスルフロソ	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	フロラスラム	1:2-420:1	1:1-140:1	2:1-27:1
1	フルアジホップ-ブチル	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	フルカルバゾン	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
1	フルセトスルフロソ	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
1	フルフェンアセト	1:257-5:1	1:85-2:1	1:32-1:4
1	フルメツラム	1:24-48:1	1:8-16:1	1:3-3:1
1	フルミクロラク-ペンチル	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
1	フルミオキサジン	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
1	フルオメツロン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	フルピルスルフロソ-メチル	1:3-336:1	1:1-112:1	2:1-21:1
1	フルリドン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	フルロキシビル	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
1	フルルタモン	1:857-2:1	1:285-1:3	1:107-1:12
1	フルチアセト-メチル	1:48-42:1	1:16-14:1	1:3-3:1
1	ホメサフェン	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
1	ホラムスルフロソ	1:13-84:1	1:4-28:1	1:1-6:1
1	グルホシネート	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
1	グリホサート	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
1	ハロスルフロソ-メチル	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	ハラウキシフェン	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
1	ハラウキシフェン メチル	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
1	ハロキシホップ-メチル	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
1	ヘキサジノン	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3

10

20

30

40

50

【表 2 1】

成分(a) (化合物番号)	成分(b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
1	ヒダントシジン	1:1100-16:1	1:385-8:1	1:144-4:1
1	イマザモキス	1:13-84:1	1:4-28:1	1:1-6:1
1	イマザピック	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
1	イマザピル	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
1	イマザキン	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
1	イマゼタベンゾ-メチル	1:171-7:1	1:57-3:1	1:21-1:3
1	イマゼタピル	1:24-48:1	1:8-16:1	1:3-3:1
1	イマゾスルフロン	1:27-42:1	1:9-14:1	1:3-3:1
1	インダノファン	1:342-4:1	1:114-2:1	1:42-1:5
1	インダジフラム	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
1	ヨードスルフロン-メチル	1:3-336:1	1:1-112:1	2:1-21:1
1	イオキシニル	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	イプフェンカルバゾン	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
1	イソプロツロン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	イソキサベン	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
1	イソキサフルトール	1:60-20:1	1:20-7:1	1:7-2:1
1	ラクトフェン	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
1	レナシル	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	リヌロン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	MCPA	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	MCPB	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
1	メコプロップ	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
1	メフェンアセト	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	メフルイジド	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	メソスルフロン-メチル	1:5-224:1	1:1-75:1	1:1-14:1
1	メソトリオン	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
1	メタミホップ	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
1	メタザクロル	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	メタゾスルフロン	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
1	メタベンズチアズロン	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
1	メトラクロル	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
1	メトスラム	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
1	メトリブジン	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	メトスルフロン-メチル	1:2-560:1	1:1-187:1	3:1-35:1
1	モリネート	1:1028-2:1	1:342-1:3	1:128-1:15

10

20

30

40

50

【表 2 2】

成分(a) (化合物番号)	成分(b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
1	ナプロップアミド	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	ナプロップアミド-M	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	ナプタラム	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	ニコスルフロソ	1:12-96:1	1:4-32:1	1:1-6:1
1	ノルフルラゾソ	1:1152-1:1	1:384-1:3	1:144-1:16
1	オルベンカルブ	1:1371-1:2	1:457-1:4	1:171-1:20
1	オルトスルファムロン	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
1	オリザリン	1:514-3:1	1:171-1:2	1:64-1:8
1	オキサジアルギル	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	オキサジアゾソ	1:548-3:1	1:182-1:2	1:68-1:8
1	オキサスルフロソ	1:27-42:1	1:9-14:1	1:3-3:1
1	オキサジクロメホン	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
1	オキシフルオルフェソ	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	パラクアット	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	ペンジメタリン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	ペノキススラム	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
1	ペントキサミド	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	ペントキサゾソ	1:102-12:1	1:34-4:1	1:12-1:2
1	フェンメジファム	1:102-12:1	1:34-4:1	1:12-1:2
1	ピクロラム	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
1	ピコリナフェソ	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
1	ピノキサデン	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
1	プレチラクロル	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	プリミスルフロソ-メチル	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
1	プロジアミン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	プロホキシジム	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
1	プロメトリン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	プロバクロル	1:1152-1:1	1:384-1:3	1:144-1:16
1	プロパニル	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	プロパキサホップ	1:48-24:1	1:16-8:1	1:6-2:1
1	プロボキシカルバゾソ	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	プロピリスルフロソ	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	プロピズアミド	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	プロスルホカルブ	1:1200-1:2	1:400-1:4	1:150-1:17
1	プロスルフロソ	1:6-168:1	1:2-56:1	1:1-11:1

10

20

30

40

50

【表 2 3】

成分(a) (化合物番号)	成分(b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
1	ピラクロニル	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
1	ピラフルフェン-エチル	1:5-224:1	1:1-75:1	1:1-14:1
1	ピラスルホトール	1:13-84:1	1:4-28:1	1:1-6:1
1	ピラゾリネート	1:857-2:1	1:285-1:3	1:107-1:12
1	ピラゾスルフロソ-エチル	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
1	ピラゾキシフェン	1:5-224:1	1:1-75:1	1:1-14:1
1	ピリベンゾオキシム	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
1	ピリプチカルブ	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	ピリデート	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
1	ピリフタリド	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
1	ピリミノバク-メチル	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
1	ピリミスルファン	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	ピリチオバク	1:24-48:1	1:8-16:1	1:3-3:1
1	ピロキサスルホン	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
1	ピロキシスラム	1:5-224:1	1:1-75:1	1:1-14:1
1	キンクロラク	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	キザロホップ-エチル	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
1	リムスルフロソ	1:13-84:1	1:4-28:1	1:1-6:1
1	サフルフェナシル	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
1	セトキシジム	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
1	シマジン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	スルコトリオン	1:120-10:1	1:40-4:1	1:15-1:2
1	スルフェントラゾン	1:147-8:1	1:49-3:1	1:18-1:3
1	スルホメツロン-メチル	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
1	スルホスルフロソ	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
1	トブチウロン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	テフリルトリオン	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
1	テンボトリオン	1:31-37:1	1:10-13:1	1:3-3:1
1	テブラロキシジム	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
1	テルバシル	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
1	テルブチルアジン	1:857-2:1	1:285-1:3	1:107-1:12
1	テルプトリン	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	テニルクロール	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
1	チアゾピル	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	チエンカルバゾン	1:3-336:1	1:1-112:1	2:1-21:1

10

20

30

40

50

【表 2 4】

成分(a) (化合物番号)	成分(b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
1	チフェンスルフロン-メチル	1:5 - 224:1	1:1 - 75:1	1:1 - 14:1
1	チアフェナシル	1:17 - 68:1	1:5 - 23:1	1:2 - 5:1
1	チオベンカルブ	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	トルピラレート	1:31 - 37:1	1:10 - 13:1	1:3 - 3:1
1	トプラムゾン	1:6 - 168:1	1:2 - 56:1	1:1 - 11:1
1	トラルコキシジム	1:68 - 17:1	1:22 - 6:1	1:8 - 2:1
1	トリアファモン	1:2 - 420:1	1:1 - 140:1	2:1 - 27:1
1	トリアラート	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	トリアスルフロン	1:5 - 224:1	1:1 - 75:1	1:1 - 14:1
1	トリアジフラム	1:171 - 7:1	1:57 - 3:1	1:21 - 1:3
1	トリベヌロン-メチル	1:3 - 336:1	1:1 - 112:1	2:1 - 21:1
1	トリクロピル	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	トリフロキシスルフロン	1:2 - 420:1	1:1 - 140:1	2:1 - 27:1
1	トリフルジモキサジン	1:25 - 45:1	1:8 - 15:1	1:3 - 3:1
1	トリフルラリン	1:288 - 4:1	1:96 - 2:1	1:36 - 1:4
1	トリフルスルフロン-メチル	1:17 - 68:1	1:5 - 23:1	1:2 - 5:1
1	トリトスルフロン	1:13 - 84:1	1:4 - 28:1	1:1 - 6:1

10

20

【0 2 8 4】

表 A 2 は、「成分 (a)」欄見出しの下項目が、以下に示すそれぞれの成分 (a) 欄の項目で置き換えられていることを除き、上記表 A 1 と同様に構成されている。成分 (a) 欄の化合物 2 が、索引表 A において特定されている。したがって、例えば、表 A 2 において、「成分 (a)」欄見出しの下項目は全て「化合物 2」(即ち、索引表 A において特定されている化合物 2) を列挙し、表 A 2 における欄見出しの下第 1 行は、化合物 2 と 2, 4 - D との混合物を具体的に開示している。表 A 3 ~ A 11 も同様に構成されている。

30

【0 2 8 5】

【表 2 5】

表番号	成分(a)欄の項目	表番号	成分(a)欄の項目
A2	化合物 2	A6	化合物 6
A3	化合物 3	A7	化合物 7
A4	化合物 4	A8	化合物 8
A5	化合物 5	A9	化合物 9

40

【0 2 8 6】

望ましくない植生のより良好な防除(例えば相乗作用(強化された効果)、防除される雑草の範囲の拡大、または、農作物の安全性の強化などによる使用量の低減)のために、または、抵抗性雑草の発生を防止するために、式 1 の化合物と、クロリムロン-エチル、ニコスルフロン、メソトリオン、チフェンスルフロン-メチル、フルピルスルフロン-メチル、トリベヌロン、ピロキサスルホン、ピノキサデン、テンボトリオン、ピロキシスラ

50

ム、メトラクロールおよび S - メトラクロールからなる群から選択される除草剤との混合物が好適である。

【 0 2 8 7 】

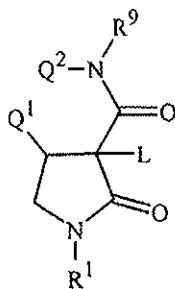
以下の試験は、特定の雑草に対する本発明の化合物の防除効能を実証する。しかしながら、これらの化合物によって得られる雑草防除はこれらの種に限定されない。化合物の説明については索引表 A を参照されたい。以下の索引表において、以下の略語が使用されている：略語「C m p d . N o .」は「化合物番号」を表す。略語「E x .」は「実施例」を表し、どの実施例においてその化合物が製造されているかを示す数字が続いている。質量スペクトルデータは、大気圧化学イオン化 (A P +) を用いて観察される、 H^+ (分子量 1) の分子への付加によって形成される親イオン ($M + 1$) であって、同位体存在度が最も高い親イオンの分子量として、 $\pm 0.5 Da$ の推定精度で報告される。

10

【 0 2 8 8 】

【表 2 6】

索引表 A



20

R^1 : Me

化合物番号	Q^1	Q^2	L	R^9	L
1 (実施例 3)	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-di-F)	L-1	H	$R^A = CH_3$
2 (実施例 2)	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-di-F)	L-3	H	$R^B, R^C = H; R^F = C(=O)CH_3$
3	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-di-F)	L-1		$-C(=O)C(CH_3)_2C(=O)-$
4 (実施例 1) (シス)	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-di-F)	L-3	H	$R^B, R^C = H; R^F = H$
5 (実施例 1) (トランス)	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-di-F)	L-3	H	$R^B, R^C = H; R^F = H$
6 (トランス)	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-di-F)	L-3	H	$R^B, R^C = H; R^F = C(=O)(CH_2)_3C(=O)OH$
7	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-di-F)	L-1	H	$R^A = N(H)CH_2CH_3$
8	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-di-F)	L-1	H	$R^A = N(H)CH(CH_3)_2$
9	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-di-F)	L-2	H	$R^B, R^C = H; R^D = CH_3; R^E \text{ is } CH_3$

30

【 0 2 8 9 】

40

50

【表 27】

索引表 B

化合物番号	質量(M+)	化合物番号	質量(M+)
1	*	6	529 (M+1)
2	*	7	470 (M+1)
3	495 (M+1)	8	484 (M+1)
4	429 (M+1)	9	454 (M-1)
5	429 (M+1)		

10

*¹H NMRデータについては、合成例を参照されたい

【0290】

本発明の生物学的実施例

試験 A

イヌビエ (エチノクロア・クルス - ガルリ (*Echinochloa crus-galli*))、ホウキギ (コチア・スコパリア (*Kochia scoparia*))、ブタクサ (common ragweed、アンプロシア・エラチオル (*Ambrosia elatior*))、イタリアンライグラス (*Italian ryegrass*、ロリウム・マルチフロラム (*Lolium multiflorum*))、エノコログサ (green foxtail、セタリア・ヴィリディス (*Setaria viridis*))、およびアカザ (アマランサス・レトロフレックス (*Amaranthus retroflexus*)) から選択される植物種の種子をローム土壌と砂とのブレンドに蒔き、界面活性剤を含む非植物毒性溶媒混合物に配合した試験化学物質を用いて直接土壌噴霧で発生前処理した。

20

【0291】

同時に、これら雑草種、ならびに、コムギ (トリチウム・アestivム (*Triticum aestivum*))、コーン (ゼア・マイズ (*Zea mays*))、ブラックグラス (アロペクルス・ミオスロイデス (*Alopecurus myosuroides*)) およびヤエムグラ (catchweed bedstraw、ガリウム・アパリネ (*Galium aparine*)) から選択される植物を同一のローム土壌と砂とのブレンドを含有するポットに植え、同様に配合した試験化学物質の発生後適用で処理した。発生後処理に関して、植物は、2 ~ 10 cm の範囲の高さであり、1 ~ 2 葉展開期のものではあった。処理した植物および未処理の対照を温室中におよそ 10 日間維持し、その後、全ての処理した植物を未処理の対照と比較し、被害について視覚的に評価した。表 A にまとめられている植物の応答評価は 0 ~ 100 スケールに基づいており、ここで、0 は効果無しであり、100 は完全な防除である。ダッシュ記号 (-) による応答は、試験結果が得られなかったことを意味する。

30

【0292】

40

【表 2 8】

表 A	化合物								
125 g ai/ha	1	2	3	4	5	6	7	8	9
発生後									
イヌビエ	90	50	70	60	80	50	10	0	90
ブラックグラス	50	10	30	40	30	0	0	0	60
コーン	80	40	80	50	60	0	0	0	50
エノコログサ	90	70	60	60	80	20	20	0	90
ヤエムグラ	60	40	50	40	40	0	30	0	60
ホウキギ	70	40	60	60	70	0	0	0	70
アカザ	80	40	60	70	50	0	30	0	80
ブタクサ	40	40	40	0	40	0	0	0	30
イタリアンライグラス	80	50	50	50	50	40	10	0	60
コムギ	50	20	40	20	30	10	0	0	60
表 A	化合物								
31 g ai/ha	1	2	3	4	5	6	7	8	9
発生後									
イヌビエ	70	0	40	0	30	0	0	0	70
ブラックグラス	0	0	20	0	0	0	0	0	50
コーン	20	0	10	0	0	0	0	0	40
エノコログサ	50	20	0	10	30	0	0	0	50
ヤエムグラ	50	0	40	20	40	0	0	0	60
ホウキギ	20	0	0	0	30	0	0	0	50
アカザ	30	20	40	30	30	0	10	0	30
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	30
イタリアンライグラス	60	20	40	0	20	0	0	0	50
コムギ	20	0	0	0	0	0	0	0	30
表 A	化合物								
125 g ai/ha	1	2	3	4	5	6	7	8	9
発生前									
イヌビエ	90	80	90	90	90	50	70	0	90
エノコログサ	90	90	90	90	90	80	80	0	90
ホウキギ	80	50	50	40	60	0	0	0	70
アカザ	90	80	100	90	60	0	10	0	80
ブタクサ	70	30	20	0	60	0	0	0	60
イタリアンライグラス	60	10	40	50	80	30	0	0	80

10

20

30

40

50

【表 29】

表 A	化合物								
31 g ai/ha	1	2	3	4	5	6	7	8	9
発生前									
イヌビエ	80	50	80	30	80	10	0	0	90
エノコログサ	90	60	90	50	70	30	0	0	90
ハウキギ	40	20	0	0	0	0	0	0	30
アカザ	50	20	20	0	0	0	0	0	70
ブタクサ	20	0	0	0	0	0	0	0	0
イタリアンライグラス	30	0	20	0	10	0	0	0	60

10

【0293】

試験 B

イネ（オリザ・サティバ（*Oryza sativa*））、タマガヤツリ（*small-flower umbrella sedge*）、シペラス・ディフォルミス（*Cyperus difformis*）、アメリカコナギ（ヘテランテラ・リモサ（*Heteranthera limosa*））、およびイヌビエ（エチノクロア・クルス・ガルリ（*Echinochloa crus-galli*））から選択される、冠水させた水田試験における植物種を試験のために2葉展開期まで成長させた。処理時に、試験ポットを土壌表面より3 cm上まで冠水させ、試験化合物を田面水に直接施用することにより処理し、次いで、この水深を試験期間中維持した。処理した植物および対照を温室中に13～15日間維持し、その後、全ての種を対照と比較し、視覚的に評価した。表Bにまとめられている植物の応答評価は0～100のスケールに基づいており、ここで、0は効果無しであり、100は完全な防除である。ダッシュ記号（-）による応答は、試験結果が得られなかったことを意味する。

20

【0294】

30

【表30】

表 B	化合物								
250 g ai/ha	1	2	3	4	5	6	7	8	9
冠水									
イヌビエ	70	65	45	50	65	60	0	0	65
アメリカコナギ	90	95	80	95	90	85	75	0	95
イネ	0	30	10	0	25	20	30	0	0
タマガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0

40

(56)参考文献 国際公開第2016/196593(WO,A1)
特表2017-506210(JP,A)
国際公開第2016/003997(WO,A1)
特表2006-513995(JP,A)

C 0 7 D
A 0 1 N
A 0 1 P
C a p l u s / R E G I S T R Y (S T N)