

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2005-521702

(P2005-521702A)

(43) 公表日 平成17年7月21日(2005.7.21)

(51) Int. Cl.⁷

A O 1 N 43/40

A O 1 N 35/10

A O 1 N 37/18

A O 1 N 37/22

A O 1 N 37/34

F I

A O 1 N 43/40

A O 1 N 43/40

A O 1 N 43/40

A O 1 N 35/10

A O 1 N 37/18

1 O 1 E

1 O 1 B

1 O 1 H

テーマコード (参考)

4 H O 1 1

A

審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全 52 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2003-579566 (P2003-579566)

(86) (22) 出願日 平成15年4月2日 (2003. 4. 2)

(85) 翻訳文提出日 平成16年12月6日 (2004. 12. 6)

(86) 国際出願番号 PCT/EP2003/003471

(87) 国際公開番号 W02003/082012

(87) 国際公開日 平成15年10月9日 (2003. 10. 9)

(31) 優先権主張番号 559/02

(32) 優先日 平成14年4月3日 (2002. 4. 3)

(33) 優先権主張国 スイス (CH)

(71) 出願人 500584309

シンジェンタ パーティシペーションズ

アクチエンゲゼルシャフト

スイス国、ツェーハー 4 0 5 8 パーゼ

ル、シュバルツバルトアレー 2 1 5

(74) 代理人 100099759

弁理士 青木 篤

(74) 代理人 100077517

弁理士 石田 敬

(74) 代理人 100087413

弁理士 古賀 哲次

(74) 代理人 100117019

弁理士 渡辺 陽一

(74) 代理人 100082898

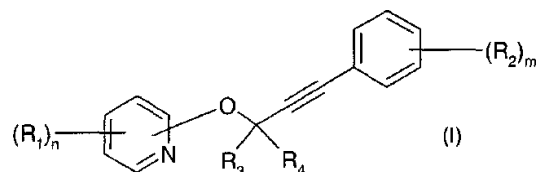
弁理士 西山 雅也

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 フェニルプロピニルオキシピリジン化合物を含有する除草剤組成物

(57) 【要約】

通例の不活性製剤補助剤を含有することに加え、a)式Iの化合物(式中、置換基 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 、並びに添え字 n 及び m は請求項1で定義した通りである)又はその化合物の農芸化学的に許容される塩、及びb)除草剤相乗作用にとって有効な量の1又は複数の補助除草剤、を含んで成る除草組成物。本発明に従う組成物は、更に毒性緩和剤を含んで成ることもある。



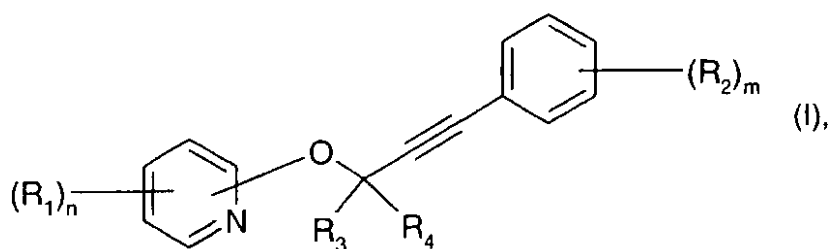
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

通例の不活性製剤補助剤を含有することに加え、活性成分として：

a) 除草剤として有効量の式 I の化合物：

【化 1】



10

(式中、

nは、0、1、2、3又は4であり；

各R₁は、独立して、ハロゲン、-CN、-SCN、-SF₅、-NO₂、-NR₅R₆、-CO₂R₇、-CONR₈R₉、-C(R₁₀)=NOR₁₁、-COR₁₂、-OR₁₃、-SR₁₄、-SOR₁₅、-SO₂R₁₆、-OSO₂R₁₇、C₁-C₈アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル又はC₃-C₆シクロアルキルであるか；又は、ハロゲン、-CN、-NO₂、-NR₁₈R₁₉、-CO₂R₂₀、-CONR₂₁R₂₂、-COR₂₃、-C(R₂₄)=NOR₂₅、-C(S)NR₂₆R₂₇、-C(C₁-C₄アルキルチオ)=NR₂₈、-OR₂₉、-SR₃₀、-SOR₃₁、-SO₂R₃₂又はC₃-C₆シクロアルキルにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキル、C₂-C₈アルケニル又はC₂-C₈アルキニルであるか；又は、

各R₁は、ハロゲン、-CN、-NO₂、-NR₁₈R₁₉、-CO₂R₂₀、-CONR₂₁R₂₂、-COR₂₃、-C(R₂₄)=NOR₂₅、-C(S)NR₂₆R₂₇、-C(C₁-C₄アルキルチオ)=NR₂₈、-SR₃₀、-SOR₃₁、-SO₂R₃₂もしくはC₃-C₆シクロアルキルにより一置換もしくは多置換されたC₃-C₆シクロアルキルであり；又は

各R₁は、独立して、フェニルであり、これは次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換され；又は

2個の隣接するR₁置換基は一緒に、1又は2個の隣接しない酸素原子により中断され且つC₁-C₆アルキルにより置換されてもよい、C₁-C₇アルキレン架橋を形成し、環原子の総数は、少なくとも5個且つ最大で9個であり；又は、2個の隣接するR₁置換基は一緒に、1又は2個の隣接しない酸素原子により中断され且つC₁-C₆アルキルにより置換されてもよい、C₂-C₇アルケニレン架橋を形成し、環原子の総数は、少なくとも5個且つ最大で9個であり；

R₃及びR₄は、各々他方から独立して、水素、ハロゲン、-CN、C₁-C₄アルキルもしくはC₁-C₄アルコキシであり；又は

R₃及びR₄は共に、C₂-C₅アルキレンであり；

R₅は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；

R₆は、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり；ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R₅及びR₆は共に、酸素もしくはイオウ原子により中断されてもよいC₂-C₅アルキレン鎖であり；

R₇は、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニルもしくはC₃-C₈アルキニルであるか、又はハロゲン、C₁-C₄アルコキシもしくはフェニルにより一置換もしくは多置換された、C₁-C₈

40

50

アルキル、 C_3 - C_8 アルケニルもしくは C_3 - C_8 アルキニルであり、ここで、フェニルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロ-アルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；

R_8 は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；

R_9 は、水素もしくは C_1 - C_8 アルキルであるか、又は $COOH$ 、 C_1 - C_8 -アルコキシカルボニルもしくは $-CN$ により、一置換もしくは多置換された C_1 - C_8 アルキルであり、又は

R_9 は、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、フェニルもしくはベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R_8 及び R_9 は共に、 C_2 - C_5 アルキレンであり；

R_{10} は、水素、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル又は C_3 - C_6 シクロアルキルであり；

R_{11} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、 C_1 - C_4 ハロアルキル又は C_3 - C_6 ハロアルケニルであり；

R_{12} は、水素、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル又は C_3 - C_6 シクロアルキルであり；

R_{13} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニルもしくは C_3 - C_8 アルキニルであり；又は

R_{13} は、フェニル又はフェニル- C_1 - C_6 アルキルであり、ここで、フェニル環は、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ もしくは $-S(O)_2$ C_1 - C_8 アルキルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R_{13} は、ハロゲン、 $-CN$ もしくは C_1 - C_4 アルコキシにより一置換もしくは多置換された、 C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{14} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニルもしくは C_3 - C_8 アルキニルであり、又はハロゲン、 $-CN$ もしくは C_1 - C_4 アルコキシにより一置換もしくは多置換された C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{15} 、 R_{16} 及び R_{17} は、各々他方から独立して、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニルもしくは C_3 - C_8 -アルキニルであるか、又はハロゲン、 $-CN$ もしくは C_1 - C_4 アルコキシにより一置換もしくは多置換された C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{18} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{19} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロ-アルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R_{18} 及び R_{19} は共に、酸素もしくはイオウ原子により中断されてもよい C_2 - C_5 アルキレン鎖であり；

R_{20} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロ-アルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；

R_{21} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{22} は、水素もしくは C_1 - C_8 アルキルであるか、又は $COOH$ 、 C_1 - C_8 -アルコキシカルボニルもしくは $-CN$ により一置換もしくは多置換された、 C_1 - C_8 アルキルであり、又は

R_{22} は、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R_{21} 及び R_{22} は共に、 C_2 - C_5 アルキレンであり；

R_{23} は、水素、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル又は C_3 - C_6 シクロアルキルであり；

- R_{24} は、水素、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル又は C_3 - C_6 シクロアルキルであり；
- R_{25} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、 C_1 - C_4 ハロアルキル又は C_3 - C_6 ハロアルケニルであり；
- R_{26} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；
- R_{27} は、水素もしくは C_1 - C_8 アルキルであるか、又は $COOH$ 、 C_1 - C_8 -アルコキシカルボニルもしくは $-CN$ により一置換もしくは多置換された、 C_1 - C_8 アルキルであり、又は
- R_{27} は、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は 10
- R_{26} 及び R_{27} は共に、 C_2 - C_5 アルキレンであり；
- R_{28} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；
- R_{29} 及び R_{30} は、各々他方から独立して、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニル又は C_3 - C_8 アルキニルであるか、又はハロゲン、 $-CN$ しくは C_1 - C_4 アルコキシにより一置換もしくは多置換された C_1 - C_8 アルキルであり；
- R_{31} 及び R_{32} は、各々他方から独立して、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニルもしくは C_3 - C_8 アルキニルであるか、又はハロゲン、 $-CN$ しくは C_1 - C_4 アルコキシにより一置換もしくは多置換された C_1 - C_8 アルキルであり；
- m は、0、1、2、3、4 又は 5 であり；
- 各 R_2 は独立して、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-SF_5$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR_{36}R_{37}$ 、 $-CO_2R_{38}$ 、 $-CONR_{38}R_{40}$ 、 $-C(R_{41})=NOR_{42}$ 、 $-COR_{43}$ 、 $-OR_{44}$ 、 $-SR_{45}$ 、 $-SOR_{46}$ 、 $-SO_2R_{47}$ 、 OSO_2R_{48} 、 $-N([CO]_pR_{49})COR_{50}$ 、 $-N(OR_{51})COR_{52}$ 、 $-N(R_{53})CO_2R_{54}$ 又は $-N$ -フタルイミドであり； 20
- R_{36} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；及び
- R_{37} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルの場合、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロ-アルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換しくは多置換されることが可能であり；又は
- R_{36} 及び R_{37} は共に、酸素もしくはイオウ原子により中断されてもよい C_2 - C_5 アルキレン鎖であり； 30
- R_{38} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニルしくは C_3 - C_8 アルキニルであるか、又はハロゲン、 C_1 - C_4 アルコキシしくはフェニルにより一置換しくは多置換された C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニル又は C_3 - C_8 アルキニルであり、ここで、フェニルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロ-アルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換しくは多置換されることが可能であり；
- R_{39} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；
- R_{40} は、水素しくは C_1 - C_8 アルキルであるか、又は $-COOH$ 、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニルしくは $-CN$ により一置換しくは多置換された C_1 - C_8 アルキルであり、又は
- R_{40} は、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換しくは多置換されることが可能であり；又は 40
- R_{39} 及び R_{40} は共に、 C_3 - C_5 アルキレンであり；
- R_{41} は、水素、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル又は C_3 - C_6 シクロアルキルであり；
- R_{42} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、 C_1 - C_4 ハロアルキル又は C_3 - C_6 ハロアルケニルであり；
- R_{43} は、水素、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル又は C_3 - C_6 シクロアルキルであり；
- R_{44} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニルしくは C_3 - C_8 アルキニルであり；又は
- R_{44} は、フェニル又はフェニル- C_1 - C_6 アルキルであり、ここで、フェニル環は、次に、ハ 50

ロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ もしくは $-S(O)_2C_1-C_8$ アルキルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり、又は
 R_{44} は、ハロゲン、 $-CN$ もしくは C_1 - C_4 アルコキシにより一置換もしくは多置換された C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{45} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニル又は C_3 - C_8 アルキニルであるか、又はハロゲン、 $-CN$ もしくは C_1 - C_4 アルコキシにより一置換もしくは多置換された C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{46} 、 R_{47} 及び R_{48} は、各々他方から独立して、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニル又は C_3 - C_8 -アルキニルであるか、又はハロゲン、 $-CN$ もしくは C_1 - C_4 アルコキシにより一置換もしくは多置換された C_1 - C_8 アルキルであり；

p は、0又は1であり；

R_{49} 、 R_{50} 、 R_{51} 、 R_{52} 、 R_{53} 及び R_{54} は、各々他方から独立して、水素、 C_1 - C_8 アルキル、又は次に、ハロゲン、 C_1 - C_8 アルキル、 C_1 - C_4 ハロ-アルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_8 アルキルチオ、 C_1 - C_8 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_8 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されてよいフェニルであり；又は

各 R_2 は独立して、 C_1 - C_8 アルキルであるか、又はハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR_{55}R_{56}$ 、 $-CO_2R_57$ 、 $-CONR_{58}R_{59}$ 、 $-COR_{60}$ 、 $-C(R_{61})=NOR_{62}$ 、 $-C(S)NR_{63}R_{64}$ 、 $-C(C_1-C_4$ アルキルチオ) $=NR_{65}$ 、 $-OR_{66}$ 、 $-SR_{67}$ 、 $-SOR_{68}$ 、 $-SO_2R_{69}$ 、 $-O(SO_2)R_{70}$ 、 $-N(R_{71})CO_2R_{72}$ 、 $-N(R_{73})COR_{74}$ もしくは C_3 - C_6 シクロアルキルにより一置換もしくは多置換された C_1 - C_8 アルキルであり；又は

各 R_2 は独立して、 C_2 - C_8 アルケニルであるか、又は $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CO_2R_{75}$ 、 $-CONR_{76}R_{77}$ 、 $-COR_{78}$ 、 $-C(R_{79})=NOR_{80}$ 、 $-C(S)NR_{81}R_{82}$ 、 $-C(C_1-C_4$ アルキルチオ) $=NR_{83}$ もしくは C_3 - C_6 シクロアルキルにより一置換もしくは多置換された C_2 - C_8 アルケニルであり；又は

各 R_2 は独立して、 C_2 - C_8 アルキニルであるか、又はハロゲン、 $-CN$ 、 $-CO_2R_{84}$ 、 $-CONR_{85}R_{86}$ 、 $-COR_{87}$ 、 $-C(R_{88})=NOR_{89}$ 、 $-C(S)NR_{90}R_{91}$ 、 $-C(C_1-C_4$ アルキルチオ) $=NR_{92}$ もしくは C_3 - C_6 シクロアルキルにより一置換もしくは多置換された C_2 - C_8 アルキニルであり；又は

各 R_2 は独立して、 C_3 - C_6 シクロアルキルであるか、又はハロゲン、 $-CN$ 、 $-CO_2R_{93}$ 、 $-CONR_{94}R_{95}$ 、 $-COR_{96}$ 、 $-C(R_{97})=NOR_{98}$ 、 $-C(S)NR_{99}R_{100}$ もしくは $-C(C_1-C_4$ アルキルチオ) $=NR_{101}$ により一置換もしくは多置換された C_3 - C_6 シクロアルキルであり；又は

2個の隣接する R_2 置換基は一緒に、1又は2個の隣接しない酸素原子により中断され、及び C_1 - C_6 アルキルにより置換されてよい、 C_1 - C_7 アルキレン架橋を形成し、環原子の総数は、少なくとも5個且つ最大で9個であり；又は、2個の隣接する R_2 置換基は一緒に、1又は2個の隣接しない酸素原子により中断され、且つ C_1 - C_6 アルキルにより置換される、 C_2 - C_7 アルケニレン架橋を形成し、環原子の総数は、少なくとも5個且つ最大で9個であり；

R_{55} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{56} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロ-アルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R_{55} 及び R_{56} は共に、酸素もしくはイオウ原子により中断されてもよい C_2 - C_5 アルキレン鎖であり；

R_{57} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニルもしくは C_3 - C_8 アルキニルであるか、又はハロゲン、 C_1 - C_4 アルコキシもしくはフェニルにより一置換もしくは多置換された C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニル又は C_3 - C_8 アルキニルであり、ここで、フェニルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロ-アルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；

R_{58} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{59} は、水素もしくは C_1 - C_8 アルキルであるか、又は $-COOH$ 、 C_1 - C_8 -アルコキシカルボニルもしくは $-CN$ により一置換もしくは多置換された C_1 - C_8 アルキルであり；又は

10

20

30

40

50

- R₅₉は、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は
- R₅₈及びR₅₉は、共に、C₂-C₅アルキレンであり；
- R₆₀は、水素、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆シクロアルキルであり；
- R₆₁は、水素、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆シクロアルキルであり；
- R₆₂は、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆ハロアルケニルであり；且つ
- R₆₃は、水素又はC₁-C₈アルキルであり； 10
- R₆₄は、水素又はC₁-C₈アルキルであるか、もしくは-COOH、C₁-C₈-アルコキシカルボニルもしくは-CNにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；又は
- R₆₄は、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は
- R₆₃及びR₆₄は、共にC₂-C₅アルキレンであり；
- R₆₅は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；
- R₆₆及びR₆₇は、各々他方から独立して、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、又はハロゲン、-CNもしくはC₁-C₄アルコキシにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり； 20
- R₆₈、R₆₉及びR₇₀は、各々他方から独立して、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル又はC₃-C₈アルキニルであるか、又はハロゲン、-CNもしくはC₁-C₄アルコキシにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；
- R₇₁及びR₇₃は、各々他方から独立して、水素、C₁-C₈アルキル又はC₁-C₈アルコキシであり；
- R₇₂は、C₁-C₈アルキルであり；
- R₇₄は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；
- R₇₅は、水素であるか、又はC₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニルもしくはC₃-C₈アルキニルであり、その各々は、ハロゲン、C₁-C₄アルコキシもしくはフェニルにより一置換もしくは多置換されることがあり、ここで、フェニルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり； 30
- R₇₆は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；
- R₇₇は、水素もしくはC₁-C₈アルキルであり、又は-COOH、C₁-C₈-アルコキシカルボニルもしくは-CNにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；又は
- R₇₇は、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は 40
- R₇₆及びR₇₇は、共にC₂-C₅アルキレンであり；
- R₇₈及びR₇₉は、各々他方から独立して、水素、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆シクロアルキルであり；
- R₈₀は、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆ハロアルケニルであり；
- R₈₁は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；
- R₈₂は、水素もしくはC₁-C₈アルキルであるか、又は-COOH、C₁-C₈-アルコキシカルボニル又は-CNにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；又は
- R₈₂は、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フ 50

エニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R_{81} 及び R_{82} は、共に、 C_2 - C_5 アルキレンであり；

R_{83} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{84} は、水素であるか、又は C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニルもしくは C_3 - C_8 アルキニルであり、各々、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルコキシもしくはフェニルにより一置換もしくは多置換されてよく、ここで、フェニルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；

10

R_{85} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{86} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであるか、又は $-COOH$ 、 C_1 - C_8 -アルコキシカルボニルもしくは $-CN$ により一置換もしくは多置換された C_1 - C_8 アルキルであり；又は

R_{86} は、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R_{85} 及び R_{86} は、共に、 C_2 - C_5 アルキレンであり；

R_{87} は、水素、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル又は C_3 - C_6 シクロアルキルであり；

R_{88} は、水素、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル又は C_3 - C_6 シクロアルキルであり；

20

R_{89} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、 C_1 - C_4 ハロアルキル又は C_3 - C_6 ハロアルケニルであり；

R_{90} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{91} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであるか、又は $-COOH$ 、 C_1 - C_8 -アルコキシカルボニルもしくは $-CN$ により一置換もしくは多置換された C_1 - C_8 アルキルであり；又は

R_{91} は、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R_{90} 及び R_{91} は共に、 C_2 - C_5 アルキレンであり；

30

R_{92} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{93} は、水素であるか、又は C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニルもしくは C_3 - C_8 アルキニルであり、その各々は、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルコキシもしくはフェニルにより一置換もしくは多置換され、ここで、フェニルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；

R_{94} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{95} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであるか、又は $-COOH$ 、 C_1 - C_8 -アルコキシカルボニルもしくは $-CN$ により一置換もしくは多置換された C_1 - C_8 アルキルであり；又は

R_{95} は、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

40

R_{94} 及び R_{95} は共に、 C_2 - C_5 アルキレンであり；

R_{96} は、水素、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル又は C_3 - C_6 シクロアルキルであり；

R_{97} は、水素、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル又は C_3 - C_6 シクロアルキルであり；

R_{98} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、 C_1 - C_4 ハロアルキル又は C_3 - C_6 ハロアルケニルであり；

R_{99} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{100} は、水素もしくは C_1 - C_8 アルキルであり、又は $-COOH$ 、 C_1 - C_8 -アルコキシカルボニルも

50

しくは-CNにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；又は
R₁₀₀は、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R₉₉及びR₁₀₀は、共に、C₂-C₅アルキレンであり；且つ、

R₁₀₁は、水素又はC₁-C₈アルキルである。）、

又は、式Iの化合物の農芸化学的に許容できる塩又はいずれかの立体異性体もしくは互変異性体、並びに

b)相乗的に有効量の補助除草剤：

トリアスルフロン(773)、プロスルフロン(657)、クロジナホップ-プロパルギル(156)、テルブトリン(740)、ジカンバ(222)、フェノキサプロップ-P-エチル(331)、メタミホップ、ジクロホップ-メチル(232)、トラルコキシジム(767)、ブトロキシジム(104)、アミドスルフロン(24)、クロルスルフロン(146)、エトキシスルフロン(307)、フルピルスルフロン(374)、フルピルスルフロン-メチル-ナトリウム(374)、メトスルフロン-メチル(536)、スルホスルフロン(714)、チフェンスルフロン-メチル(754)、トリベヌロン-メチル(778)、イマザメタベンズ-メチル(438)、フルカルバゾン-ナトリウム(357)、イオドスルフロン-メチル-ナトリウム(454)、フロラスラム(351)、フルメトスラム(366)、メトスラム(533)、クロトトルロン(142)、イソプロツロン(464)、メタベンズチアズロン(510)、プロモキシニル(93)、イオキシニル(455)、ピリデート(672)、ピフェノックス(75)、フルオログリコフェン-エチル(371)、カルフェントラゾン-エチル(119)、フルアゾレート(355)、ジフルフェニカン(245)、フルルタモン(382)、グリフォセート(407)、スルフォセート(407)、グルフォシネート(406)、S-グルフォシネート、ビアラフォス(ビラナフォス(bilanafos)；(77))、エタルフルラリン(298)、ペンジメタリン(599)、2,4-DB(211)、ジクロルプロップ(2,4-DP；(228))、MCPA(485)、MCPB(487)、メコプロブ(MCPP；(489))、メコプロブ-P(490)、クロピラリド(162)、フルロキシピル(380)、キンメラク(quinmerac)(682)、ベナゾリン-エチル(59)、ジフェンゾコートメチル硫酸(242)、シハロホップ-ブチル(191)、トリフルラリン(791)、フルチアミド(フルフェナセット；(362))、イソキサベン(466)、プロスルフオカルブ(656)、トリアレート(772)、2,4-D(205)；ベンフルアミド、シニドン-エチル(152)、フルフェンピル、ピコリナフェン(コード番号AC900001；(621))、プロポキシカルバゾン(コード番号MKH6561；(541))；プレチラクロール(632)、シノスルフロン(154)、フェンクロリム(325)、ピリフタリド(コード番号CGA279233)、メトラクロール(529)、S-メトラクロール(530)、メトラクロール及びS-メトラクロールの混合物、好ましくは50～90%、特に70～90%S-メトラクロールを含有する混合物、ベンスルフロン-メチル(66)、イマゾスルフロン(444)、ピラゾスルフロン-エチル(665)、アジムスルフロン(45)、エスプロカルブ(296)、メフェナセット(491)、モリネート(542)、プロパニル(644)、ピラゾレート(ピラゾリネート；(663))、フェノキサプロップ-エチル(「The Pesticide Manual」、C. Tomlin編集、第10版、British Crop Protection Council、1994年、記載番号(299))、ビスピリバック(82)、ビスピリバック-ナトリウム(82)、ピリミノバック-メチル(676)、カフェンストロール(108)、オキサジクロメフォン(コード番号MY-100；(583))、ディムロン(ダイムロン；(207))、フェントラザミド(コード番号NBA061；(340))、インダノファン(コード番号MK243；(450))、エトベンザニド(コード番号HW-52；(311))、オキサジアルギル(578)、ハロスルフロン-メチル(414)、クロマゾン(159)、オキサジアゾン(579)、ベンゾビシクロン(コード番号SAN1315H；(70))、メフェンピル-ジエチル(492)；プロホキシジム(コード番号BAS625H；(54))、ピラゾギル；シクロスルファミロン(186)、フラザスルフロン(349)、フルフェナセット(362)、ベンフレセート(63)、ベントゾン(69)、プロモブチド(91)、ジチオピル(275)、エタメトスルフロン-メチル(299)、フラムプロップ-M(348)、メチルディムロン(521)、キンクロラック(681)、チアゾピル(752)及びメゾスルフロン、から成る群から選択される1又は複数の化合物、の混合物、を含んで成る選択的除草組成物。

10

20

30

40

50

【請求項 2】

有用植物の農作物の望ましくない植物生育を防除する方法であって、除草剤として有効量の請求項1記載の組成物を、農作物植物又はそれらの栽培領域に作用させることを含む、方法。

【請求項 3】

農作物植物は、穀物、コメ又はトウモロコシである、請求項2記載の方法。

【請求項 4】

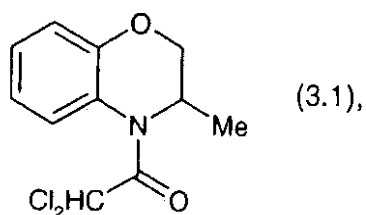
有用植物の農作物は、該組成物で、1～5000g/haの活性成分総量に相当する散布率で処理される、請求項2記載の方法。

【請求項 5】

通例の不活性製剤補助剤、例えば担体、溶媒及び展着剤を含有することに加え、ab)除草剤相乗作用に有効な量の、請求項1記載の式Iの化合物、及び請求項1記載のb)に列記された補助除草剤から選択された1種又は複数の化合物、並びに
c)除草剤拮抗作用に有効な量の、
式3.1の化合物

10

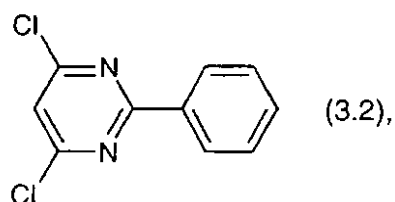
【化 2】



20

及び、式3.2の化合物

【化 3】

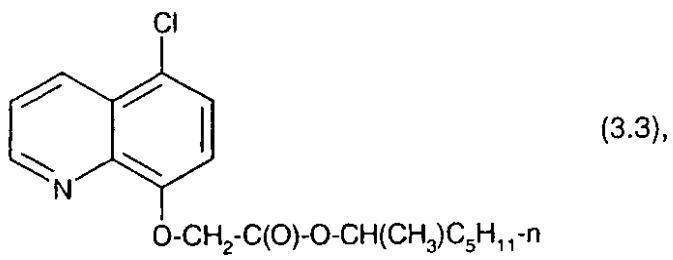


30

及び、式3.3の化合物

40

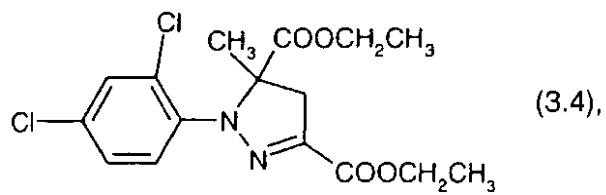
【化 4】



10

、並びにその遊離酸及び塩、
及び、式3.4の化合物、

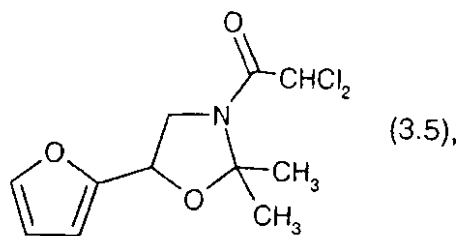
【化 5】



20

、並びにその遊離酸及び塩、
及び、式3.5の化合物、

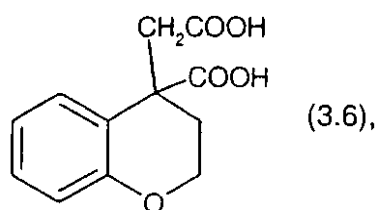
【化 6】



40

及び、式3.6の化合物、

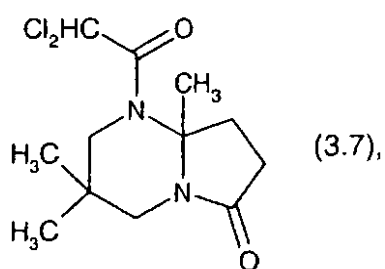
【化 7】



10

及び、式3.7の化合物、

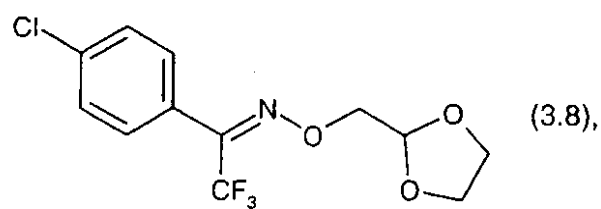
【化 8】



20

及び、式3.8の化合物、

【化 9】



30

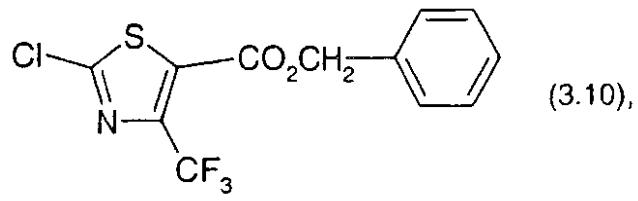
及び、式3.9の化合物、

 $\text{Cl}_2\text{CHCON}(\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2)_2$ (3.9)

及び、式3.10の化合物、

40

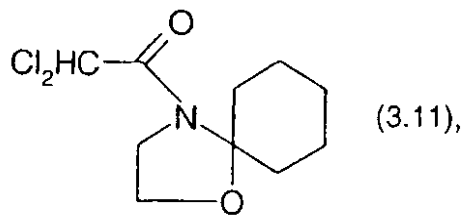
【化 1 0】



10

及び、式3.11の化合物、

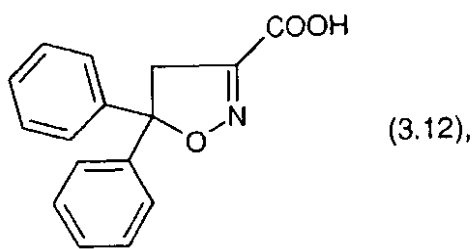
【化 1 1】



20

及び、式3.12の化合物、

【化 1 2】

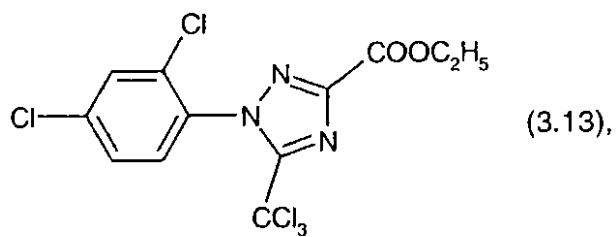


30

、及びそのエチルエステル、

及び、式3.13の化合物、

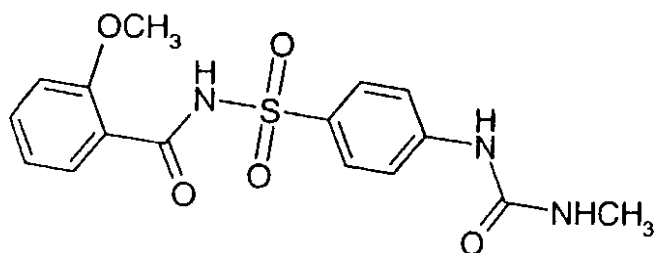
【化 1 3】



40

50

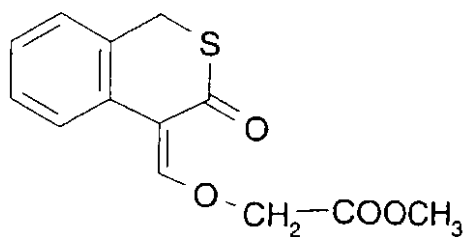
及び、式3.14の化合物、
【化14】



(3.14),

10

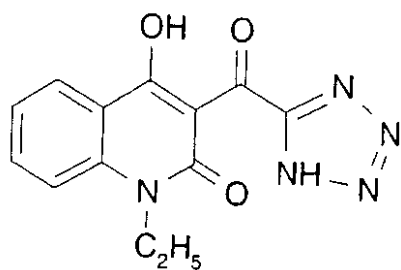
及び、式3.15の化合物、
【化15】



(3.15),

20

及び、式3.16の化合物、
【化16】



(3.16).

30

40

から選択される化合物、
の混合物を活性成分として含んで成る、選択的除草組成物。

【請求項6】

有用植物の農作物における雑草及び草の選択的防除方法であって、除草剤相乗作用に有効な量の請求項5記載の組成物で、有用植物、それらの種子もしくは挿し木、又はそれらの栽培領域を処理することを含む、方法。

【請求項7】

除草剤の散布率は、1～5000g/haであり、且つ毒性緩和剤 (safener) の散布率は、0.001～0.5kg/haである、請求項6記載の方法。

50

【請求項 8】

有用植物の農作物は、穀物、コメ又はトウモロコシである、請求項6記載の方法。

【請求項 9】

担体、溶媒及び展着剤のような、通例の不活性製剤補助剤を含有することに加え、下記の混合物を活性成分として含有する、選択的除草剤組成物：

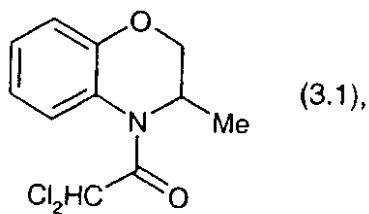
a) 除草剤として有効な量の、請求項 1 記載の式 I の化合物、及び

c) 除草剤拮抗作用に有効な量の：

式 3.1 の化合物

【化 1 7】

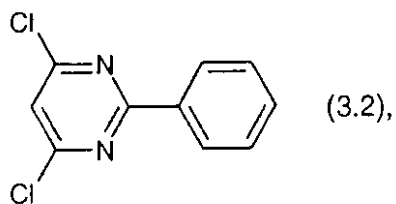
10



及び、式 3.2 の化合物

20

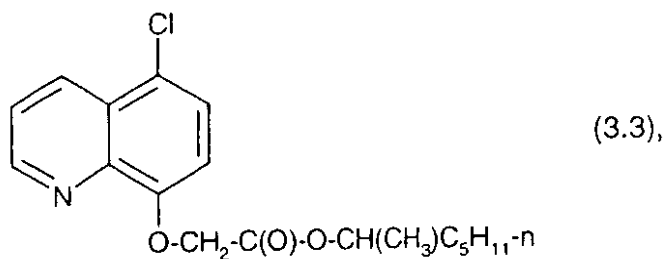
【化 1 8】



30

及び、式 3.3 の化合物

【化 1 9】

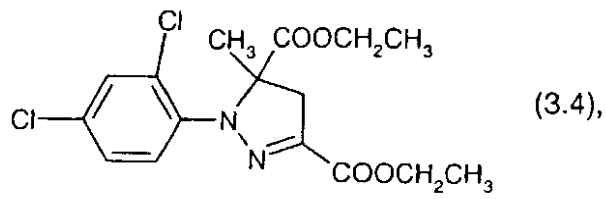


40

、並びにその遊離酸及び塩、

及び、式 3.4 の化合物、

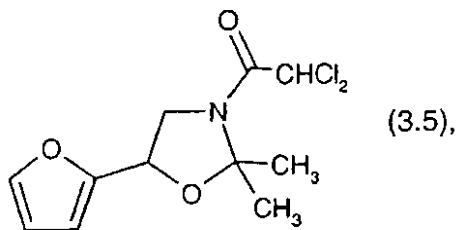
【化 2 0】



10

、並びにその遊離酸及び塩、
及び、式3.5の化合物、

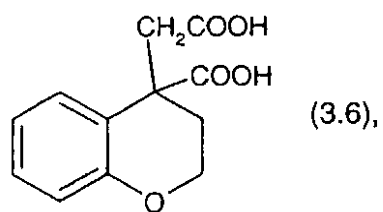
【化 2 1】



20

及び、式3.6の化合物、

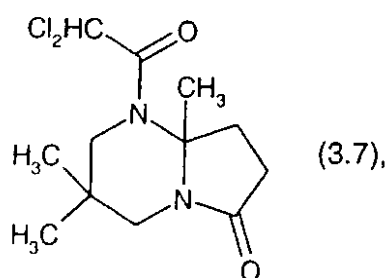
【化 2 2】



30

及び、式3.7の化合物、

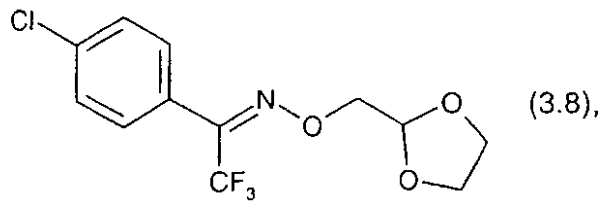
【化 2 3】



40

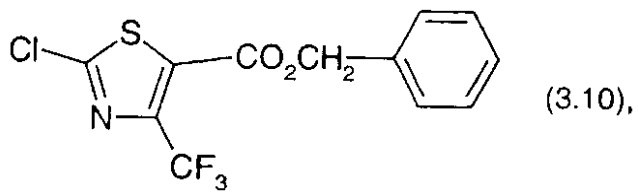
50

及び、式3.8の化合物、
【化24】



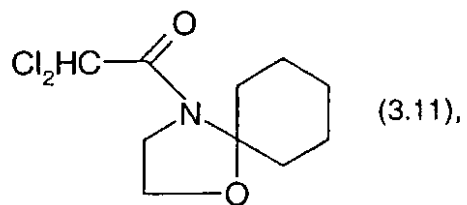
10

及び、式3.9の化合物、
 $\text{Cl}_2\text{CHCON}(\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2)_2$ (3.9)
及び、式3.10の化合物、
【化25】



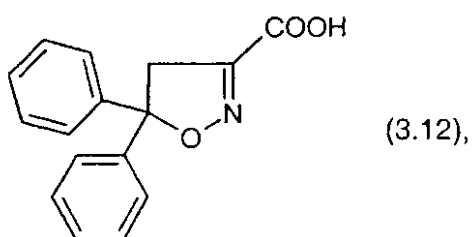
20

及び、式3.11の化合物、
【化26】



30

及び、式3.12の化合物、
【化27】

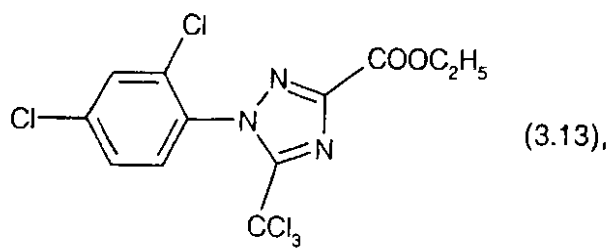


40

、及びそのエチルエステル、

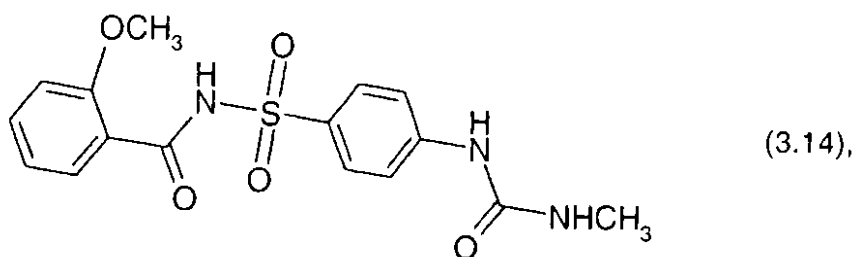
50

及び、式3.13の化合物、
【化 2 8】



10

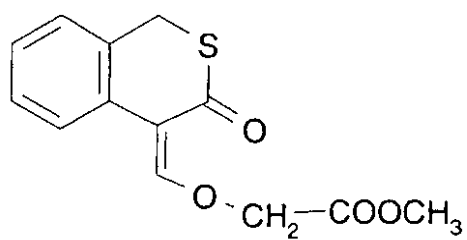
及び、式3.14の化合物、
【化 2 9】



20

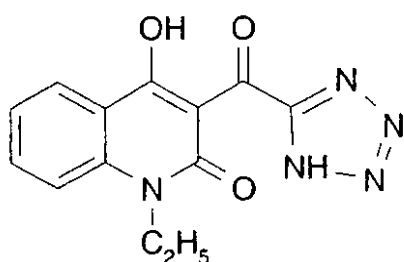
及び、式3.15の化合物、
【化 3 0】

(3.15),



及び、式3.16の化合物、

【化 3 1】



(3.16).

10

、の混合物を活性成分として含んで成る、選択的除草組成物。

【請求項 10】

有用植物の農作物における雑草及び草の選択的防除方法であって、除草剤相乗作用に有効な量の請求項9記載の組成物で、有用植物、それらの種子もしくは挿し木、又はそれらの栽培領域を処理することを含む、方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

20

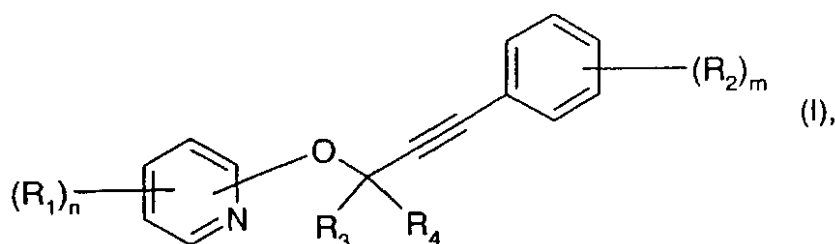
本発明は、有用植物の農作物、例えば、綿花、ダイズ、テンサイ、サトウキビ、農園作物(plantation crop)、ナタネ、並びに特に穀物、コメ及びトウモロコシなどの農作物の中の雑草の選択的防除に適した、除草性活性成分の組合せを含有する、新規除草剤組成物に関する。本発明は、有用植物の農作物中の雑草を防除する方法、並びにその目的のための新規組成物の使用にも関する。

【0002】

式Iの化合物：

【化 1】

30



(I),

(式中、置換基 R_1 から R_4 、並びに添え字 n 及び m は、以下に定義されている。)は、除草性活性を示す。式Iの化合物及びそれらの調製は、例えば、国際公開公報第02/28182号において開示されている。

40

【0003】

驚くべきことに、可変の量の活性成分、すなわち式Iの化合物の様々な量の活性成分と、以下に示した公知であり及びその一部は市販もされている除草性活性成分の1種又は複数との組合せは、特に有用植物の農作物中に生じる雑草の大半が、出芽前及び出芽後の両方で、防除することが可能である相乗作用を発揮することが現在わかっている。

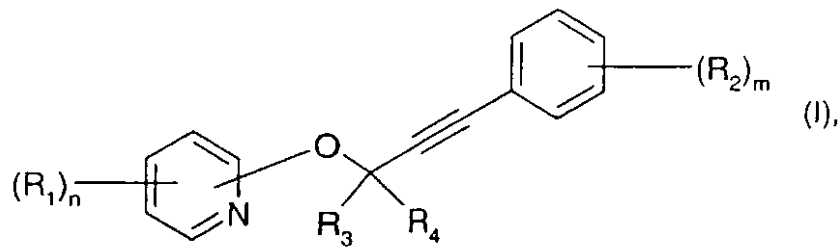
【0004】

従って、本発明に従い、通例の不活性製剤補助剤を含有することに加え、活性成分として：

50

a) 除草剤として有効な量の式Iの化合物：

【化2】



10

(式中、

nは、0、1、2、3又は4であり；

各R₁は、独立して、ハロゲン、-CN、-SCN、-SF₅、-NO₂、-NR₅R₆、-CO₂R₇、-CONR₈R₉、-C(R₁₀)=NOR₁₁、-COR₁₂、-OR₁₃、-SR₁₄、-SOR₁₅、-SO₂R₁₆、-OSO₂R₁₇、C₁-C₈アルキル、C₂-C₈アルケニル、C₂-C₈アルキニル又はC₃-C₆シクロアルキルであるか；又は、ハロゲン、-CN、-NO₂、-NR₁₈R₁₉、-CO₂R₂₀、-CONR₂₁R₂₂、-COR₂₃、-C(R₂₄)=NOR₂₅、-C(S)NR₂₆R₂₇、-C(C₁-C₄アルキルチオ)=NR₂₈、-OR₂₉、-SR₃₀、-SOR₃₁、-SO₂R₃₂又はC₃-C₆シクロアルキルにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキル、C₂-C₈アルケニル又はC₂-C₈アルキニルであるか；又は、

各R₁は、ハロゲン、-CN、-NO₂、-NR₁₈R₁₉、-CO₂R₂₀、-CONR₂₁R₂₂、-COR₂₃、-C(R₂₄)=NOR₂₅、-C(S)NR₂₆R₂₇、-C(C₁-C₄アルキルチオ)=NR₂₈、-SR₃₀、-SOR₃₁、-SO₂R₃₂もしくはC₃-C₆シクロアルキルにより一置換もしくは多置換されたC₃-C₆シクロアルキルであり；又は

各R₁は、独立して、フェニルであり、これは次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されてもよく；又は2個の隣接するR₁置換基は一緒に、1又は2個の隣接しない酸素原子により中断され且つC₁-C₆アルキルにより置換されてもよい、C₁-C₇アルキレン架橋を形成し、環原子の総数は、少なくとも5個且つ最大で9個であり；又は、2個の隣接するR₁置換基は一緒に、1又は2個の隣接しない酸素原子により中断され及びC₁-C₆アルキルにより置換されてもよい、C₂-C₇アルケニレン架橋を形成し、環原子の総数は、少なくとも5個且つ最大で9個であり；

R₃及びR₄は、各々他方から独立して、水素、ハロゲン、-CN、C₁-C₄アルキルもしくはC₁-C₄アルコキシであり；又は

R₃及びR₄は共に、C₂-C₅アルキレンであり；

R₅は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；

R₆は、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり；これは、フェニル及びベンジルについて次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R₅及びR₆は共に、酸素もしくはイオウ原子により中断されてもよいC₂-C₅アルキレン鎖であり；

R₇は、水素、C₁-C₆アルキル、C₃-C₈アルケニルもしくはC₃-C₈アルキニルであるか、又はハロゲン、C₁-C₄アルコキシもしくはフェニルにより一置換もしくは多置換された、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニルもしくはC₃-C₈アルキニルであり、これはフェニルについて次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-

50

C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；

R₈は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；

R₉は、水素もしくはC₁-C₈アルキルであるか、又はCOOH、C₁-C₈-アルコキシカルボニルもしくは-CNにより、一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり、又は

R₉は、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニルもしくはベンジルであり、これはフェニル及びベンジルについて次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R₈及びR₉は共に、C₂-C₅アルキレンであり；

10

R₁₀は、水素、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆シクロアルキルであり；

R₁₁は、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆ハロアルケニルであり；

R₁₂は、水素、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆シクロアルキルであり；

R₁₃は、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニルもしくはC₃-C₈アルキニルであり；又は

R₁₃は、フェニル又はフェニル-C₁-C₆アルキルであり、ここで、フェニル環は、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂もしくは-S(O)₂C₁-C₈アルキルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R₁₃は、ハロゲン、-CNもしくはC₁-C₄アルコキシにより一置換もしくは多置換された、C₁-C₈アルキルであり；

20

R₁₄は、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニルもしくはC₃-C₈アルキニルであり、又はハロゲン、-CNもしくはC₁-C₄アルコキシにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；

R₁₅、R₁₆及びR₁₇は、各々他方から独立して、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニルもしくはC₃-C₈-アルキニルであるか、又はハロゲン、-CNもしくはC₁-C₄アルコキシにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；

R₁₈は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；

R₁₉は、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

30

R₁₈及びR₁₉は共に、酸素もしくはイオウ原子により中断されてもよいC₂-C₅アルキレン鎖であり；

R₂₀は、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；

R₂₁は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；

40

R₂₂は、水素もしくはC₁-C₈アルキルであるか、又はCOOH、C₁-C₈-アルコキシカルボニルもしくは-CNにより一置換もしくは多置換された、C₁-C₈アルキルであり、又は

R₂₂は、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R₂₁及びR₂₂は共に、C₂-C₅アルキレンであり；

R₂₃は、水素、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆シクロアルキルであり；

R₂₄は、水素、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆シクロアルキルであり；

R₂₅は、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、C₁-C₄ハロアルキル

50

又は C_3 - C_6 ハロアルケニルであり；

R_{26} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{27} は、水素もしくは C_1 - C_8 アルキルであるか、又は $COOH$ 、 C_1 - C_8 -アルコキシカルボニルもしくは $-CN$ により一置換もしくは多置換された、 C_1 - C_8 アルキルであり、又は

R_{27} は、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R_{26} 及び R_{27} は共に、 C_2 - C_5 アルキレンであり；

R_{28} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{29} 及び R_{30} は、各々他方から独立して、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニル又は C_3 - C_8 アルキニルであるか、又はハロゲン、 $-CN$ もしくは C_1 - C_4 アルコキシにより一置換もしくは多置換された C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{31} 及び R_{32} は、各々他方から独立して、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニルもしくは C_3 - C_8 アルキニルであるか、又はハロゲン、 $-CN$ もしくは C_1 - C_4 アルコキシにより一置換もしくは多置換された C_1 - C_8 アルキルであり；

m は、0、1、2、3、4又は5であり；

各 R_2 は独立して、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-SF_5$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR_{36}R_{37}$ 、 $-CO_2R_{38}$ 、 $-CONR_{38}R_{40}$ 、 $-C(R_{41})=NOR_{42}$ 、 $-COR_{43}$ 、 $-OR_{44}$ 、 $-SR_{45}$ 、 $-SOR_{46}$ 、 $-SO_2R_{47}$ 、 OSO_2R_{48} 、 $-N([CO]_pR_{49})COR_{50}$ 、 $-N(OR_{51})COR_{52}$ 、 $-N(R_{53})CO_2R_{54}$ 又は $-N$ -フタルイミドであり；

R_{36} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；及び

R_{37} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R_{36} 及び R_{37} は共に、酸素もしくはイオウ原子により中断されてもよい C_2 - C_5 アルキレン鎖であり；

R_{38} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニルもしくは C_3 - C_8 アルキニルであるか、又はハロゲン、 C_1 - C_4 アルコキシもしくはフェニルにより一置換もしくは多置換された C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニル又は C_3 - C_8 アルキニルであり、ここで、フェニルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；

R_{39} は、水素又は C_1 - C_8 アルキルであり；

R_{40} は、水素もしくは C_1 - C_8 アルキルであるか、又は $-COOH$ 、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニルもしくは $-CN$ により一置換もしくは多置換された C_1 - C_8 アルキルであり、又は

R_{40} は、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニルもしくは C_1 - C_4 アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R_{39} 及び R_{40} は共に、 C_3 - C_5 アルキレンであり；

R_{41} は、水素、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル又は C_3 - C_6 シクロアルキルであり；

R_{42} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニル、 C_3 - C_8 アルキニル、 C_1 - C_4 ハロアルキル又は C_3 - C_6 ハロアルケニルであり；

R_{43} は、水素、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル又は C_3 - C_6 シクロアルキルであり；

R_{44} は、水素、 C_1 - C_8 アルキル、 C_3 - C_8 アルケニルもしくは C_3 - C_8 アルキニルであり；又は

R_{44} は、フェニル又はフェニル- C_1 - C_6 アルキルであり、ここで、フェニル環は、次に、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ もしくは $-S(O)_2C_1$ - C_8 アルキルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり、又は

10

20

30

40

50

R₄₄は、ハロゲン、-CNもしくはC₁-C₄アルコキシにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；

R₄₅は、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル又はC₃-C₈アルキニルであるか、又はハロゲン、-CNもしくはC₁-C₄アルコキシにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；

R₄₆、R₄₇及びR₄₈は、各々他方から独立して、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル又はC₃-C₈-アルキニルであるか、又はハロゲン、-CNもしくはC₁-C₄アルコキシにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；

pは、0又は1であり；

R₄₉、R₅₀、R₅₁、R₅₂、R₅₃及びR₅₄は、各々他方から独立して、水素、C₁-C₈アルキル、又は次に、ハロゲン、C₁-C₈アルキル、C₁-C₄ハロ-アルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₈アルキルチオ、C₁-C₈アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₈アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されてよいフェニルであり；又は

各R₂は独立して、C₁-C₈アルキルであるか、又はハロゲン、-CN、-NO₂、-NR₅₅R₅₆、-CO₂R₅₇、-CONR₅₈R₅₉、-COR₆₀、-C(R₆₁)=NOR₆₂、-C(S)NR₆₃R₆₄、-C(C₁-C₄アルキルチオ)=NR₆₅、-OR₆₆、-SR₆₇、-SOR₆₈、-SO₂R₆₉、-O(SO₂)R₇₀、-N(R₇₁)CO₂R₇₂、-N(R₇₃)COR₇₄もしくはC₃-C₆シクロアルキルにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；又は

各R₂は独立して、C₂-C₈アルケニルであるか、又は-CN、-NO₂、-CO₂R₇₅、-CONR₇₆R₇₇、-COR₇₈、-C(R₇₉)=NOR₈₀、-C(S)NR₈₁R₈₂、-C(C₁-C₄アルキルチオ)=NR₈₃もしくはC₃-C₆シクロアルキルにより一置換もしくは多置換されたC₂-C₈アルケニルであり；又は

各R₂は独立して、C₂-C₈アルキニルであるか、又はハロゲン、-CN、-CO₂R₈₄、-CONR₈₅R₈₆、-COR₈₇、-C(R₈₈)=NOR₈₉、-C(S)NR₉₀R₉₁、-C(C₁-C₄アルキルチオ)=NR₉₂もしくはC₃-C₆シクロアルキルにより一置換もしくは多置換されたC₂-C₈アルキニルであり；又は

各R₂は独立して、C₃-C₆シクロアルキルであるか、又はハロゲン、-CN、-CO₂R₉₃、-CONR₉₄R₉₅、-COR₉₆、-C(R₉₇)=NOR₉₈、-C(S)NR₉₉R₁₀₀もしくは-C(C₁-C₄アルキルチオ)=NR₁₀₁により一置換もしくは多置換されたC₃-C₆シクロアルキルであり；又は

2個の隣接するR₂置換基は一緒に、1又は2個の隣接しない酸素原子により中断され、且つC₁-C₆アルキルにより置換されてよい、C₁-C₇アルキレン架橋を形成し、環原子の総数は、少なくとも5個且つ最大で9個であり；又は、2個の隣接するR₂置換基は一緒に、1又は2個の隣接しない酸素原子により中断され、及びC₁-C₆アルキルにより置換される、C₂-C₇アルケニレン架橋を形成し、環原子の総数は、少なくとも5個且つ最大で9個であり；

R₅₅は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；

R₅₆は、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり、これは、フェニル及びベンジルについて次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロ-アルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R₅₅及びR₅₆は共に、酸素もしくはイオウ原子により中断されてもよいC₂-C₅アルキレン鎖であり；

R₅₇は、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニルもしくはC₃-C₈アルキニルであるか、又はハロゲン、C₁-C₄アルコキシもしくはフェニルにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル又はC₃-C₈アルキニルであり、これは、フェニルについて次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロ-アルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；

R₅₈は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；

R₅₉は、水素もしくはC₁-C₈アルキルであるか、又は-COOH、C₁-C₈-アルコキシカルボニルもしくは-CNにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；又は

R₅₉は、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄ア

ルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は
 R₅₈及びR₅₉は、共に、C₂-C₅アルキレンであり；
 R₆₀は、水素、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆シクロアルキルであり；
 R₆₁は、水素、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆シクロアルキルであり；
 R₆₂は、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆ハロアルケニルであり；及び
 R₆₃は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；
 R₆₄は、水素又はC₁-C₈アルキルであるか、もしくは-COOH、C₁-C₈-アルコキシカルボニルもしくは-CNにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；又は 10
 R₆₄は、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は
 R₆₃及びR₆₄は、共にC₂-C₅アルキレンであり；
 R₆₅は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；
 R₆₆及びR₆₇は、各々他方から独立して、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、又はハロゲン、-CNもしくはC₁-C₄アルコキシにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；
 R₆₈、R₆₉及びR₇₀は、各々他方から独立して、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル又はC₃-C₈アルキニルであるか、又はハロゲン、-CNもしくはC₁-C₄アルコキシにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり； 20
 R₇₁及びR₇₃は、各々他方から独立して、水素、C₁-C₈アルキル又はC₁-C₈アルコキシであり；
 R₇₂は、C₁-C₈アルキルであり；
 R₇₄は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；
 R₇₅は、水素、又はC₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニルもしくはC₃-C₈アルキニルであり、その各々は、ハロゲン、C₁-C₄アルコキシもしくはフェニルにより一置換もしくは多置換され、ここで、フェニルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり； 30
 R₇₆は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；
 R₇₇は、水素もしくはC₁-C₈アルキルであり、又は-COOH、C₁-C₈-アルコキシカルボニルもしくは-CNにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；又は
 R₇₇は、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は
 R₇₆及びR₇₇は、共にC₂-C₅アルキレンであり；
 R₇₈及びR₇₉は、各々他方から独立して、水素、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆シクロアルキルであり； 40
 R₈₀は、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆ハロアルケニルであり；
 R₈₁は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；
 R₈₂は、水素もしくはC₁-C₈アルキルであるか、又は-COOH、C₁-C₈-アルコキシカルボニル又は-CNにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；又は
 R₈₂は、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は 50

R₈₁及びR₈₂は、共に、C₂-C₅アルキレンであり；

R₈₃は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；

R₈₄は、水素であるか、又はC₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニルもしくはC₃-C₈アルキニルであり、各々、ハロゲン、C₁-C₄アルコキシもしくはフェニルにより一置換もしくは多置換されてよく、ここで、フェニルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；

R₈₅は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；

R₈₆は、水素又はC₁-C₈アルキルであるか、又は-COOH、C₁-C₈-アルコキシカルボニルもしくは-CNにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；又は

R₈₆は、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R₈₅及びR₈₆は、共に、C₂-C₅アルキレンであり；

R₈₇は、水素、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆シクロアルキルであり；

R₈₈は、水素、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆シクロアルキルであり；

R₈₉は、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆ハロアルケニルであり；

R₉₀は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；

R₉₁は、水素又はC₁-C₈アルキルであるか、又は-COOH、C₁-C₈-アルコキシカルボニルもしくは-CNにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；又は

R₉₁は、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R₉₀及びR₉₁は共に、C₂-C₅アルキレンであり；

R₉₂は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；

R₉₃は、水素であるか、又はC₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニルもしくはC₃-C₈アルキニルであり、その各々は、ハロゲン、C₁-C₄アルコキシもしくはフェニルにより一置換もしくは多置換され、ここで、フェニルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；

R₉₄は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；

R₉₅は、水素又はC₁-C₈アルキルであるか、又は-COOH、C₁-C₈-アルコキシカルボニルもしくは-CNにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；又は

R₉₅は、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R₉₄及びR₉₅は共に、C₂-C₅アルキレンであり；

R₉₆は、水素、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆シクロアルキルであり；

R₉₇は、水素、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆シクロアルキルであり；

R₉₈は、水素、C₁-C₈アルキル、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、C₁-C₄ハロアルキル又はC₃-C₆ハロアルケニルであり；

R₉₉は、水素又はC₁-C₈アルキルであり；

R₁₀₀は、水素もしくはC₁-C₈アルキルであり、又は-COOH、C₁-C₈-アルコキシカルボニルもしくは-CNにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；又は

R₁₀₀は、C₃-C₈アルケニル、C₃-C₈アルキニル、フェニル又はベンジルであり、ここで、フェニル及びベンジルは、次に、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄ア

10

20

30

40

50

ルコキシ、-CN、-NO₂、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニルもしくはC₁-C₄アルキルスルホニルにより一置換もしくは多置換されることが可能であり；又は

R₉₉及びR₁₀₀は、共に、C₂-C₅アルキレンであり；及び、

R₁₀₁は、水素又はC₁-C₈アルキルである。）、

又は、式Iの化合物の農芸化学的に許容できる塩又はいずれかの立体異性体もしくは互変異性体、並びに

b)相乗的に有効量の補助除草剤 (co-herbicide)：

トリアスルフロン(773)、プロスルフロン(657)、クロジナホップ-プロパルギル(156)、テルブトリン(740)、ジカンバ(222)、フェノキサプロップ-P-エチル(331)、メタミホップ、ジクロホップ-メチル(232)、トラルコキシジム(767)、ブトロキシジム(104)、アミドスルフロン(24)、クロルスルフロン(146)、エトキシスルフロン(307)、フルピルスルフロン(374)、フルピルスルフロン-メチル-ナトリウム(374)、メトスルフロン-メチル(536)、スルホスルフロン(714)、チフェンスルフロン-メチル(754)、トリベヌロン-メチル(778)、イマザメタベンズ-メチル(438)、フルカルバゾン-ナトリウム(357)、イオドスルフロン-メチル-ナトリウム(454)、フロラスラム(351)、フルメトスラム(flumetsulam)(366)、メトスラム(533)、クロロトルロン(142)、イソプロツロン(464)、メタベンズチアズロン(510)、ブロモキシニル(93)、イオキシニル(455)、ピリデート(672)、ビフェノックス(75)、フルオログリコフェン(fluoroglycofen)-エチル(371)、カルフェントラゾン-エチル(119)、フルアゾレート(355)、ジフルフェニカン(245)、フルルタモン(flurtamone)(382)、グリフォセート(407)、スルフォサート(407)、グルフォシネート(406)、S-グルフォシネート、ピアラフォス(ピラナフォス(bilanafos)；(77))、エタルフルラリン(298)、ペンジメタリン(599)、2,4-DB(211)、ジクロルプロップ(2,4-DP；(228))、MCPA(485)、MCPB(487)、メコプロブ(MCPP；(489))、メコプロブ-P(490)、クロピラリド(162)、フルロキシピル(380)、キンメラク(quinmerac)(682)、ベナゾリン-エチル(59)、ジフェンゾコートメチル硫酸(242)、シハロホップ-ブチル(191)、トリフルラリン(791)、フルチアミド(fluthiamide)(フルフェナセット；(362))、イソキサベン(466)、プロスルフォカルブ(prosulfocarb)(656)、トリアレート(772)、2,4-D(205)；ベンフルアミド、シニドン(cinidon)-エチル(152)、フルフェンピル、ピコリナフェン(コード番号AC900001；(621))、プロポキシカルバゾン(コード番号MKH6561；(541))；プレチラクロール(632)、シノスルフロン(154)、フェンクロリム(325)、ピリフタリド(コード番号CGA279233)、メトラクロール(529)、S-メトラクロール(530)、メトラクロール及びS-メトラクロールの混合物、好ましくは50～90%、特に70～90%S-メトラクロールを含有する混合物、ベンスルフロン-メチル(66)、イマゾスルフロン(444)、ピラゾスルフロン-エチル(665)、アジムスルフロン(45)、エスプロカルブ(296)、メフェナセット(491)、モリネート(542)、プロパニル(644)、ピラゾレート(ピラゾリネート；(663))、フェノキサプロップ-エチル(「The Pesticide Manual」、C. Tomlin編集、第10版、British Crop Protection Council、1994年、記載番号(299))、ビスピリバック(82)、ビスピリバック-ナトリウム(82)、ピリミノバック-メチル(676)、カフェンストロール(108)、オキサジクロメフォン(コード番号MY-100；(583))、ディムロン(ダイムロン；(207))、フェントラザミド(コード番号NBA061；(340))、インダノファン(コード番号MK243；(450))、エトベンザニド(コード番号HW-52；(311))、オキサジアルギル(578)、ハロスルフロン-メチル(414)、クロマゾン(159)、オキサジアゾン(579)、ベンゾビシクロン(コード番号SAN1315H；(70))、メフェンピル-ジエチル(492)；プロホキシジム(コード番号BAS625H；(54))、ピラゾギル；シクロスルファミロン(186)、フラザスルフロン(349)、フルフェナセット(362)、ベンフレセート(63)、ベントゾン(69)、ブロモブチド(91)、ジチオピル(275)、エタメトスルフロン-メチル(299)、フラムプロップ-M(348)、メチルディムロン(521)、キンクロラック(681)、チアゾピル(752)及びメゾスルフロン、から成る群から選択される1又は複数の化合物、の混合物、を含んで成る、雑草の選択的防除のための新規相乗作用組成物が提示される。

【0005】

前記b)に列記された除草性活性成分は公知であり、例えば、「The Pesticide Manual」

10

20

30

40

50

、編集者C.D.S. Tomlin、第12版、British Crop Protection Council、2000年に、括弧内に記された登録番号で説明されている；例えば、トリアスルフロン(773)は、登録番号773として説明されている。

【0006】

グルフォシネート(406)のS-エナンチオマーであるS-グルフォシネートは、のCAS登録番号[35597-44-5]で登録されている。

【0007】

メタミホップ(Dongbu Hannong社；コード番号DBH129)は、除草剤として公知であり、及びCAS登録番号[256412-89-2]で登録されている。

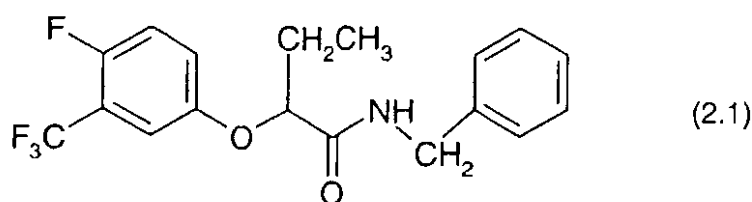
【0008】

フルアゾレート(Monsanto社；コード番号JV-485、MON 48500)も、一般名イソプロパゾールで、除草剤として公知であり、CAS登録番号[174514-07-9]で登録されている。

【0009】

式2.1の化合物：

【化3】



は、一般名ベンフルアミド(UBE社；コード番号UBH 820)で、除草剤として公知であり、CAS登録番号[113604-08-7]で登録されている。

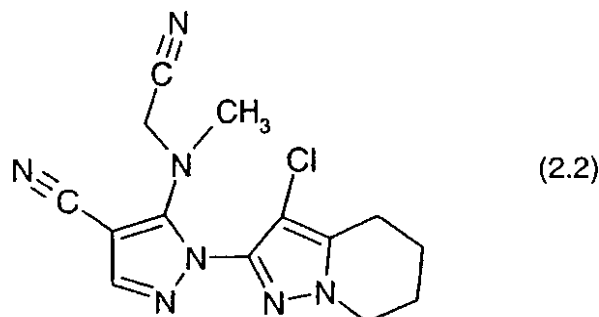
【0010】

フルフェンピルは、除草剤として公知であり、及びCAS登録番号[188489-06-7]で登録されている。

【0011】

式2.2の化合物：

【化4】



は、一般名ピラゾギル(Aventis社；コード番号AEB172391)で、除草剤として公知であり、CAS登録番号[158353-15-2]で登録されている。

【0012】

式2.3の化合物：

10

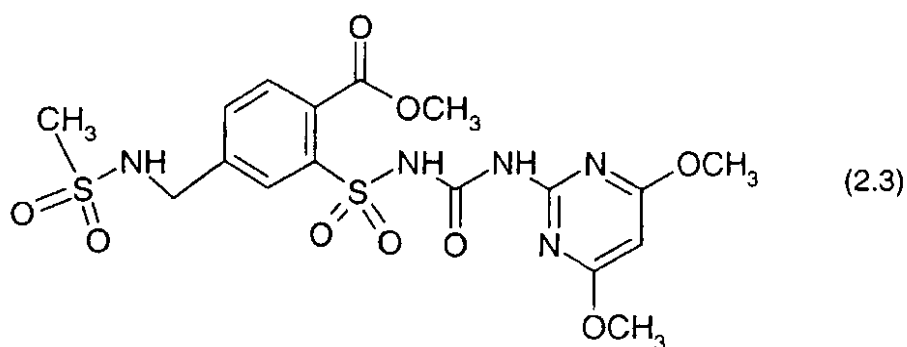
20

30

40

50

【化 5】



10

は、一般名メゾスルフロン(Aventis社；コード番号AEF130060)で、除草剤として公知であり、CAS登録番号[208465-21-8]で登録されている。

【0013】

ピリフタリド及びその調製物は、例えば、欧州特許登録第0 447 506号において開示されている。

20

【0014】

本発明は、酸の水素を有する式Iの化合物、特にカルボン酸基(例えば、カルボキシル-置換アルキル、アルケニル及びアルキニル基)を有する誘導体は、アミン、アルカリ金属及びアルカリ土類金属又は第4級アンモニウム塩基により形成することができるそれらの塩も含む。塩形成剤として使用されるアルカリ金属及びアルカリ土類金属の水酸化物の中で、リチウム、ナトリウム、カリウム、マグネシウム及びカルシウムの水酸化物、特にナトリウム及びカリウムのそれが強調される。

【0015】

考えられるアンモニウム塩形成のための適当なアミンの例は、アンモニアに加え、第1級、第2級及び第3級C₁-C₁₈アルキルアミン、C₁-C₄ヒドロキシアルキルアミン及びC₂-C₄アルコキシアルキルアミンであり、例えばメチルアミン、エチルアミン、n-プロピルアミン、イソプロピルアミン、4種のブチルアミン異性体、n-アミルアミン、イソアミルアミン、ヘキシルアミン、ヘプチルアミン、オクチルアミン、ノニルアミン、デシルアミン、ペンタデシルアミン、ヘキサデシルアミン、ヘプタデシルアミン、オクタデシルアミン、メチル-エチルアミン、メチル-イソプロピルアミン、メチル-ヘキシルアミン、メチル-ノニルアミン、メチル-ペンタデシルアミン、メチル-オクタデシルアミン、エチル-ブチルアミン、エチル-ヘプチルアミン、エチル-オクチルアミン、ヘキシル-ヘプチルアミン、ヘキシル-オクチルアミン、ジメチルアミン、ジエチルアミン、ジ-n-プロピルアミン、ジイソプロピルアミン、ジ-n-ブチルアミン、ジ-n-アミルアミン、ジイソアミルアミン、ジヘキシルアミン、ジヘプチルアミン、ジオクチルアミン、エタノールアミン、n-プロパノールアミン、イソプロパノールアミン、N,N-ジエタノールアミン、N-エチルプロパノールアミン、N-ブチル-エタノールアミン、アリルアミン、n-ブテニル-2-アミン、n-ペンテニル-2-アミン、2,3-ジメチルブテニル-2-アミン、ジブテニル-2-アミン、n-ヘキセニル-2-アミン、プロピレンジアミン、トリメチルアミン、トリエチル-アミン、トリ-n-プロピルアミン、トリイソプロピルアミン、トリ-n-ブチルアミン、トリイソブチルアミン、トリ-sec-ブチルアミン、トリ-n-アミルアミン、メトキシエチルアミン及びエトキシエチルアミン；複素環式アミン、例えば、ピリジン、キノリン、イソキノリン、モルホリン、ピペリジン、ピロリジン、インドリン、キヌクリジン及びアゼピン；第1級アリールアミン、例えばアニリン、メトキシアニリン、エトキシアニリン、o-、m-及びp-トルイジン、フェニレンジアミン、ベンジジン、ナフチルアミン並びにo-、m-及びp-クロロアニリンであり；

30

40

50

しかし、特にトリエチルアミン、イソプロピルアミン及びジイソプロピルアミンである。

【0016】

好ましい式Iの化合物は、各 R_1 が、独立して、ハロゲン、-CN、-NO₂、-C(R_{10})=NOR₁₁、-OR₁₃、-SO₂R₁₆、-OSO₂R₁₇、C₁-C₈アルキルもしくはC₂-C₈アルケニルであるか、又はハロゲンもしくは-CNにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；

R_{10} が、水素又はC₁-C₄アルキルであり；且つ、

R_{11} が、C₁-C₈アルキルであるものである。

【0017】

同じく好ましいのは、各 R_2 が、独立して、ハロゲン、-CN、-NO₂、-NR₃₆R₃₇、-CO₂R₃₈、-C(R_{41})=NOR₄₂、-OR₄₄、-SO₂R₄₇、-OSO₂R₄₈もしくはC₁-C₈アルキルであるか、又はハロゲン、-CNもしくは-CO₂R₅₇により一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；

R_{36} 及び R_{37} が、水素であり；

R_{38} が、水素又はC₁-C₈アルキルであり；

R_{41} が、水素又はC₁-C₄アルキルであり；且つ、

R_{42} が、C₁-C₈アルキルである、式Iの化合物でもある。

10

【0018】

特に好ましい式Iの化合物の群は、各 R_1 が、独立して、ハロゲン、-CN、-NO₂、-C(R_{10})=NOR₁₁、-OR₁₃、-SO₂R₁₆、-OSO₂R₁₇、C₁-C₈アルキルもしくはC₂-C₈アルケニルであるか、又は-CNにより一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；

R_{10} が、水素又はC₁-C₄アルキルであり；

R_{11} が、C₁-C₈アルキルであり

各 R_2 が、独立して、ハロゲン、-CN、-NO₂、-NR₃₆R₃₇、-CO₂R₃₈、-C(R_{41})=NOR₄₂、-OR₄₄、-SO₂R₄₇、-OSO₂R₄₈もしくはC₁-C₈アルキルであるか、又は-CNもしくは-CO₂R₅₇により一置換もしくは多置換されたC₁-C₈アルキルであり；

R_{36} 及び R_{37} が、水素であり；

R_{38} が、水素又はC₁-C₈アルキルであり；

R_{41} が、水素又はC₁-C₄アルキルであり；

R_{42} が、C₁-C₈アルキルであり；且つ

R_3 及び R_4 が、各々他方から独立して水素又はC₁-C₄アルキルであるような化合物を含む。

20

【0019】

同じく興味深いのは、 R_1 が、ハロゲン又は-CNであるか、又は-CNにより置換されたC₁-C₈アルキルであるか、又はC₁-C₈アルコキシである、式Iの化合物である。

30

【0020】

非常に特別に好ましいのは、 R_2 が、ハロゲン、-CN、-CNで置換されたC₁-C₈アルキルであるか、又はC₁-C₈アルコキシであり、特に置換基 R_1 又は R_2 の少なくとも一方が、-CNにより置換されたC₁-C₈アルキルである、式Iの化合物で与えられる。

【0021】

好ましくは、 n が0、1又は2であり、且つ m が0、1、2、3又は4であり、特に n が1又は2であり、且つ m が1又は2である式Iの化合物でも与えられる。

【0022】

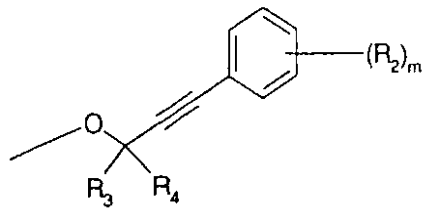
特に興味深いのは、 R_3 及び R_4 が水素である、式Iの化合物である。

40

【0023】

式Iの化合物の突出している基において、当該：

【化 6】



10

は、ピリジン環の2-位を占拠しており、好ましくは、 n は1又は2であり、且つ R_1 は、ピリジン環の3-及び／又は5-位を占拠している。

【0024】

m が1又は2であり、且つ R_2 がフェニル環の3-位を占拠している式Iの化合物も好ましい。

【0025】

R_1 は、水素、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメチル又はイソプロピルチオであり； R_2 は、シアノメチル、塩素又は臭素であり； R_3 及び R_4 は、水素であり； n は、1又は2であり、且つ m は1である式Iの化合物も強調されるべきである。

20

【0026】

穀物の農作物における雑草及び草を防除するための本発明の好ましい相乗的な混合物は、b)に列記された補助除草剤として：トリアスルフロン、プロスルフロン、クロジナホップ-プロパルギル、テルブトリン、フェノキサプロップ-P-エチル、ジクロホップ-メチル、トラルコキシジム、ブトロキシジム、アミドスルフロン、クロルスルフロン、エトキシルスルフロン、フルピルスルフロン-メチル-ナトリウム、メトスルフロン-メチル、スルホスルフロン、チフェンスルフロン-メチル、トリベヌロン-メチル、イマザメタベンズ-メチル、フルカルバゾン-ナトリウム、ヨードスルフロン-メチル-ナトリウム、フロラスラム、フルメトスラム、メトスラム、クロルトルロン、メタベンズチアズロン、プロモキシニル、ピリデート、ピフェノックス、フルオログリコフェン-エチル、カルフェントラゾン-エチル、フルアゾレート、シハロホップ-ブチル、アジムスルフロン、ベンスルフロン-メチル、シノスルフロン、シクロスルファミロン、フェントラザミド、フラザスルフロン、フルアゾレート、ベンタゾン、エタメトスルフロン-メチル、ハロスルフロン-メチル、キンクロラック、イマゾスルフロン、ピラゾスルフロン-エチル、ベンフルアミド、シニドン-エチル、フルフェンピル、ピコリナフェン及びプロポキシカルバゾン、の群から選択される化合物を含んで成る。

30

【0027】

コメの農作物における雑草及び草を防除するための本発明の好ましい相乗的な混合物は、b)に列記された補助除草剤として：プレチラクロール、シノスルフロン、トリアスルフロン、フェンクロリム、ピリフタリド、クロジナホップ-プロパルギル、メトラクロール、S-メトラクロール、メトラクロール及びS-メトラクロールの混合物、好ましくは50～90%、特に70～90% S-メトラクロールを含有するそれらの混合物、ベンスルフロン-メチル、イマゾスルフロン、ピラゾスルフロン-エチル、メトスルフロン-メチル、アジムスルフロン、メフェナセツト、シハロホップ-ブチル、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、カフェンストロール、グリフォセート、S-グルフォシネート、グルフォシネート、スルフォサート、ハロスルフロン-メチル、オキサジアゾン、メフェンピル-ジエチル、インダノファン、プロホキシジム及びピラゾギル、の群から選択される化合物を含んで成る。

40

【0028】

更に好ましい穀物又はコメの農作物における雑草及び草を防除するための本発明の好ま

50

しい相乗的な混合物は、b)に列記された補助除草剤として：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、プロモキシニル、カルフェントラゾン-エチル、クロルスルフロン、シノスルフロン、クロジナホップ-プロパルギル、シクロスルファミロン、シハロフォップ-ブチル、ジカンバ、ジクロホップ-メチル、エトキシスルフロン、フェノキサプロップ-P-エチル、フラザスルフロン、フロラスラム、フルアゾレート、フルフェナセット、フルピルスルフロン、フルピルスルフロン-メチル-ナトリウム、スルホスルフロン、チフェンスルフロン、トリアスルフロン、トリベヌロン-メチル、ベンフレセート、ペンタゾン、プロモブチド、ジチオピル、エタメトスルフロン-メチル、フラムプロップ-M、フルオログリコフェン-エチル、ハロスルフロン-メチル、メフェナセット、メチルディムロン、ピリデート、キンクロラック、キンメラク、チアゾピル、トラルコキシジム、イマゾスルフロン、インダノファン、MCPA、MCPB、ピラゾスルフロン-エチル及びメゾスルフロン、の群から選択される化合物を含んで成る。

10

【0029】

式Iの化合物のb)に列記された補助除草剤から選択された1種又は複数の活性成分との組合せが、基本的に予想される防除されるべき雑草に対する相加作用に勝り、その結果特にふたつの点で個別の活性成分の作用の範囲を広げることは非常に驚くべきことである：第一に、式Iの個々の化合物及びb)に列記された補助除草剤の散布率が低下すると同時に、作用の良好なレベルが維持される点、並びに第二に、本発明の組成物は、個別の物質が、低い散布率の範囲において、作物栽培学的観点から仮に立たない場合であっても、高レベルの雑草防除を実現する点である。この結果は、活性成分の意図しない過量の事象において必要であり及び望ましいような、雑草の範囲のかなりの拡張、及び有用植物の農作物に関する選択性の追加的増加である。本発明の組成物は、有用植物の農作物における雑草の優れた防除を維持しつつも、後作においてより大きい柔軟性ももたらす。

20

【0030】

本発明の組成物は、非常に多数の農業的に重要な雑草に対して使用することができ、例として、ハコベ(*Stellaria*)、キンレンカ(*Nasturtium*)、ヌカボ(*Agrostis*)、メヒシバ(*Digitaria*)、カラスムギ(*Avena*)、エノコログサ(*Setaria*)、シロガラシ(*Sinapis*)、ボウムギ(*Lolium*)、イヌホオズキ(*Solanum*)、インゲンマメ(*Phaseolus*)、イヌビエ(*Echinochloa*)、ホタルイ(*Scirpus*)、ミズアオイ(*Monochoria*)、オモダカ(*Sagittaria*)、チャヒキ(*Brumus*)、スズメノテッポウ(*Alopecurus*)、セイバンモロコシ(*Sorghum halepense*)、ツノア 30
イアシ(*Rottboellia*)、カヤツリグサ(*Cyperus*)、イチビ(*Abutilon*)、アメリカキンゴジカ(*Sida*)、オナモミ(*Xanthium*)、ヒユ(*Amaranthus*)、アカザ(*Chenopodium*)、ヒルガオ(*Ipomoea*)、フランスギク(*Chrysanthemum*)、ヤエムグラ(*Galium*)、スミレ(*Viola*)及びムシタサ(*Veronica*)がある。本発明の組成物は、例えば、出芽前散布、出芽後散布及び種子粉衣のような、農業において通常使用される散布の全ての方法に適している。本発明の組成物は、例えば、ナタネ、テンサイ、サトウキビ、農園作物、ダイズ、並びに特に、穀物、コメ及びトウモロコシのような、有用植物の農作物における雑草の防除、並びに非-選択的雑草防除に特に適している。

30

【0031】

「農作物」は、育種又は遺伝子操作の常法の結果として、除草剤又は除草剤群に耐性を生じる農作物も意味すると理解されるべきである。

40

【0032】

本発明の組成物は、式Iの化合物及びb)に列記された補助除草剤を、任意の混合比で含有するが、しかし通常一方の成分が他方よりも過剰である。一般に、式Iの化合物及びb)に列記された補助除草剤の混合比(質量比)は、1:2000から2000:1、特に200:1から1:200である。

【0033】

散布率は、広い限界内を変動してもよく、土壌の性質、散布法(出芽前又は出芽後；種子粉衣；作条への散布；不耕起散布など)、農作物植物、防除されるべき雑草、支配的な気候条件、並びに散布法、散布時間及び標的作物により支配される他の要因によって決ま 50

る。本発明の活性成分混合物は、一般に、1ha当り活性成分混合物1～5000gの割合で散布される。

【0034】

式Iの化合物とb)に列記された補助除草剤の混合物は、未修飾型、すなわちその合成で得られるもので使用することができる。しかし好ましくは、製剤技術において通常使用される補助剤、例えば、溶媒、固形担体又は界面活性剤と共に、通例の方式で、例えば乳化可能な濃縮物、直接噴霧可能又は希釈可能な液剤、希乳剤、水和散剤、可溶性散剤、粉剤、顆粒剤又はマイクロカプセル剤などへと配合される。組成物の性質に応じて、噴霧、アトマイザー、打粉、湿潤、飛散又は注水のような散布法が、意図された目的及び支配的な環境に従い選択される。

10

【0035】

式Iの化合物及びb)に列記された補助除草剤、及び適当である場合は、1種又は複数の固形又は液体の製剤補助剤も含有する製剤、すなわち、組成物、調製物又は混合物は、例えば、活性成分の製剤補助剤、例えば、溶媒又は固形担体との均質混合及び／又は粉碎により、それ自身公知の様式で調製される。加えて、表面-活性化合物(界面活性剤)も、製剤の調製に使用することができる。

【0036】

溶媒及び固形担体の例は、例えば、国際公開公報第97/34485号、6頁に開示されている。

【0037】

配合される式Iの化合物の性質に応じて、適当な表面-活性化合物は、良好な乳化、分散及び湿潤特性を有する、非イオン性、カチオン性及び／又はアニオン性界面活性剤並びに界面活性剤混合物である。

20

適当なアニオン性、非イオン性及びカチオン性界面活性剤の例は、例えば、国際公開公報第97/34485号、7及び8頁に開示されている。

【0038】

同じく本発明の除草剤組成物の調製に適しているのは、製剤技術において通常使用される界面活性剤であり、これは特に「McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual」、MC Publishing社、リッジウッド、NJ、1981年、Stache, H.、「Tensid-Taschenbuch」、Carl Hanser Verlag、ミュンヘン／ウィーン、1981年、並びにM.及びJ. Ash、「Encyclopedia of Surfactants」、第I-III巻、Chemical Publishing社、NY、1980-81年に記されている。

30

【0039】

除草製剤は、通常、式Iの化合物を、b)に列記された補助除草剤と共に含む、0.1～99重量%、特に0.1～95重量%の活性成分混合物、1～99.9重量%の固形又は液体製剤補助剤、並びに0～25重量%、特に0.1～25重量%の界面活性剤を含有する。

【0040】

市販の製品は好ましくは、通常濃縮物として配合されるが、最終使用者は普通は希釈した配合物を使用する。これらの組成物は更に、安定剤、例えば植物油又はエポキシ化された植物油(エポキシ化されたココナッツ油、ナタネ油又はダイズ油)、消泡剤、例えばシリコーン油、保存剤、粘度調節剤、結合材、増粘剤、及び更に肥料又は他の活性成分なども含有してもよい。好ましい製剤は、特に下記組成物を含む：

40

(% = 重量%)

【0041】

乳化可能な濃縮物：

活性成分混合物：1～90%、好ましくは5～20%

界面活性剤：1～30%、好ましくは10～20%

液体担体：5～94%、好ましくは70～85%

粉剤：

活性成分混合物：0.1～10%、好ましくは0.1～5%

50

固形担体：99.9～90%、好ましくは99.9～99%

懸濁剤濃縮物：

活性成分混合物：5～75%、好ましくは10～50%

水：94～24%、好ましくは88～30%

界面活性剤：1～40%、好ましくは2～30%

水和散剤：

活性成分混合物：0.5～90%、好ましくは1～80%

界面活性剤：0.5～20%、好ましくは1～15%

固形担体：5～95%、好ましくは15～90%

顆粒剤：

活性成分混合物：0.1～30%、好ましくは0.1～15%

固形担体：99.5～70%、好ましくは97～85%

10

【0042】

下記実施例は、本発明を例証しているが、本発明を限定するものではない。

【表1】

F1. 乳化可能な濃縮物

	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	5%	10%	25%	50%
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	6%	8%	6%	8%
ポリグリコールエーテルひまし油 (エチレンオキシド36mol)	4%	—	4%	4%
オクチルフェノールポリグリコールエーテル (エチレンオキシド7-8mol)	—	4%	—	2%
シクロヘキサノン	—	—	10%	20%
芳香族炭化水素混合物C ₉ -C ₁₂	85%	78%	55%	16%

20

30

任意な望ましい濃度の乳剤は、水による希釈によりそのような濃縮物から得ることができる。

【0043】

【表2】

F2. 液剤

	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	5%	10%	50%	90%
1-メトキシ-3-(3-メトキシプロポキシ)-プロパン	—	20%	20%	—
ポリエチレングリコールMW400	20%	10%	—	—
N-メチル-2-ピロリドン	—	—	30%	10%
芳香族炭化水素混合物C ₉ -C ₁₂	75%	60%	—	—

40

50

これらの溶液は、微小液滴の形での使用に適している。

【0044】

【表3】

F3. 水和散剤

	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	5%	25%	50%	80%
リグノスルホン酸ナトリウム	4%	—	3%	—
ラウリル硫酸ナトリウム	2%	3%	—	4%
ジイソブチルナフタレン-スルホン酸ナトリウム	—	6%	5%	6%
オクチルフェノールポリグリコールエーテル (エチレンオキシド7-8mol)	—	1%	2%	—
高度に分散されたケイ酸	1%	3%	5%	10%
カオリン	88%	62%	35%	—

10

活性成分は、補助剤と共に十分に混合され、そしてこの混合物は、適当なミルにおいて完全に粉碎され、所望の濃度の懸濁剤を生じるように、水で希釈することができる水和散剤をもたらす。

20

【0045】

【表4】

F4. コート顆粒剤

	a)	b)	c)
活性成分混合物	0.1%	5%	15%
高度に分散されたケイ酸	0.9%	2%	2%
無機担体(直径0.1-1mm)、例えばCaCO ₃ 又はSiO ₂	99.0%	93%	83%

30

活性成分を、塩化メチレンに溶解し、そして噴霧により担体に塗布し、次に溶媒を真空除去する。

【0046】

40

【表 5】

F5. コート顆粒剤

	a)	b)	c)
活性成分混合物	0.1%	5%	15%
ポリエチレングリコールMW200	1.0%	2%	3%
高度に分散されたケイ酸	0.9%	1%	2%
無機担体(直径0.1-1mm)、例えばCaCO ₃ 又はSiO ₂	98.0%	92%	80%

10

細かく粉碎した活性成分を、ポリエチレングリコールで加湿した担体に、ミキサー中で均質に塗布した。粉状でないコートされた顆粒剤をこの方法で得た。

【0047】

【表 6】

20

F6. 押出顆粒剤

	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	0.1%	3%	5%	15%
リグノスルホン酸ナトリウム	1.5%	2%	3%	4%
カルボキシメチルセルロース	1.4%	2%	2%	2%
カオリン	97.0%	93%	90%	79%

30

活性成分は、混合し、補助剤と共に粉碎し、そしてこの混合物を、水で加湿する。この混合物を押出し、その後空気流れ中で乾燥する。

【0048】

【表 7】

F7. 粉剤

	a)	b)	c)
活性成分混合物	0.1%	1%	5%
タルク	39.9%	49%	35%
カオリン	60.0%	50%	60%

40

用時調製用粉剤は、活性成分を、担体と混合し、そして適当なミル中で混合物を粉碎することにより得られる。

【0049】

50

【表 8】

F8. 懸濁剤濃縮物

	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	3%	10%	25%	50%
エチレングリコール	5%	5%	5%	5%
ノニルフェノールポリグリコールエーテル (エチレンオキシド15mol)	—	1%	2%	—
リグノスルホン酸ナトリウム	3%	3%	4%	5%
カルボキシメチルセルロース	1%	1%	1%	1%
37%ホルムアルデヒド水溶液	0.2%	0.2%	0.2%	0.2%
シリコーン油乳剤	0.8%	0.8%	0.8%	0.8%
水	87%	79%	62%	38%

10

細かく粉碎した活性成分を、補助剤と均質混合し、懸濁剤濃縮物を得、これから任意な
所望の濃度の懸濁剤を、水で希釈することにより得た。

20

【0050】

これは、個別に配合され、及び次に塗布直前に、水中で、「タンク混合」の形で塗布器
具内で所望の混合比と一緒にされる式Iの化合物及びb)に列記された1種又は複数の混合パ
ートナーについて、より実践的であることが多い。

【0051】

生物学的実施例：

相乗的な作用は、式Iの化合物及びb)に列記された同時除草性活性成分組合せの作用が
、個別に散布されたこれらの活性成分の作用の合計よりも大きい場合には常に存在する。

【0052】

2種の除草剤の所定の組合せに関し予想される除草作用Weは、下記のように計算するこ
とができる(COLBY, S.R., 「Calculating synergistic and antagonistic response of h
erbicide combinations」、Weeds、15:20-22(1967)参照)：

30

$$We = X + [Y \cdot (100 - X) / 100]$$

(式中：

X=未処理の防除(=0%)と比べた、1ha当りpkgの散布率での式Iの化合物による処理時の
除草作用の%。

Y=未処理の防除と比べた、1ha当りqkgの散布率でのb)に列記された補助除草剤による処
理時の除草作用の%。

We=1ha当り活性成分p+qkgの散布率での式Iの化合物及びb)に列記された補助除草剤によ
る処理後の予想された除草作用(未処理の防除と比較した除草作用の割合))。

40

【0053】

実際に観察された作用が予想されたWe値よりも大きい場合、相乗的な作用が存在する。

【0054】

式Iの化合物のb)に列記された補助除草剤との組合せの相乗的な作用は、下記実施例に
おいて明らかにされる。

【0055】

実験の説明—出芽前試験：

単子葉及び双子葉被験植物を、プラスチック製ポット中の標準土壌に蒔く。蒔いた直後
に、被験化合物を、噴霧により、水性懸濁剤を散布する(1ha当り水500L)。散布率は、圃

50

場条件及び温室条件下で決定された最適濃度によって決まる。その後これらの被験植物を、温室内で、最適条件下で生育する。これらの試験は、36日後に評価した(%作用率、100% = 植物は枯死、0% = 植物毒性作用なし)。この試験で使用した混合物は、良好な結果を示す。

【0056】

実験の説明－出芽後試験：

被験植物は、プラスチック製ポット内で、温室条件下で2-から3-枚葉期まで生育する。標準土壌を、耕作基層として使用した。2-から3枚-葉期で、除草剤を、単独及び混合物の両方で、被験植物に散布する。散布は、1ha当たり水500Lで、被験化合物の水性懸濁剤を用いて行う。散布率は、圃場条件及び温室条件下で決定された最適濃度によって決まる。これらの試験は、33日後に評価した(%作用率、100% = 植物は枯死、0% = 植物毒性作用なし)。この試験においても、混合物は、良好な結果を示す。

10

【0057】

驚くべきことに、特定の毒性緩和剤(safener)が、本発明の相乗的な組成物との混合に適していることが示されている。従って本発明は、式Iの化合物、b)に列記された補助除草剤から選択された1種又は複数の化合物、及びその除草剤の植物毒性作用に対し雑草ではなく有用植物を保護する毒性緩和剤(対抗剤、解毒剤)を含有する、有用植物の農作物、特に穀物、コメ及びトウモロコシの農作物において草及び雑草を防除する選択的な除草剤組成物に加え、有用植物の農作物における雑草の防除におけるそのような組成物の使用にも関する。

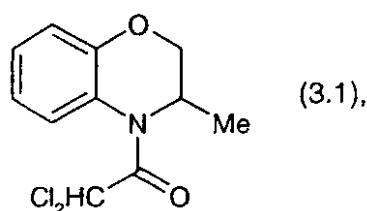
20

【0058】

従って、本発明に従い、担体、溶媒及び展着剤のような通例の不活性製剤補助剤に加え、活性成分として、ab)除草剤相乗作用にとって有効量の式Iの化合物及びb)に列記された補助除草剤から選択された1種又は複数の混合物、並びにc)除草剤拮抗作用にとって有効量の下記化合物から選択された化合物を含有する、選択的除草剤組成物が提唱されている：

式3.1の化合物

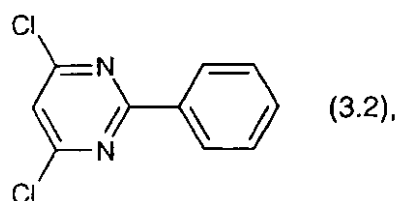
【化7】



30

及び、式3.2の化合物

【化8】

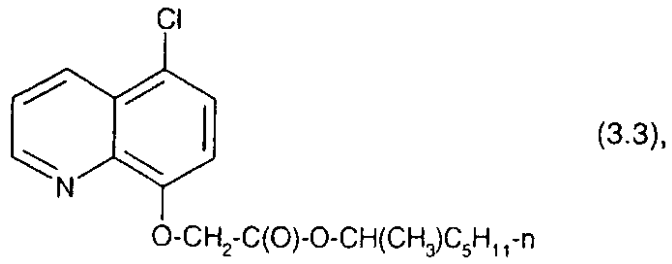


40

50

及び、式3.3の化合物

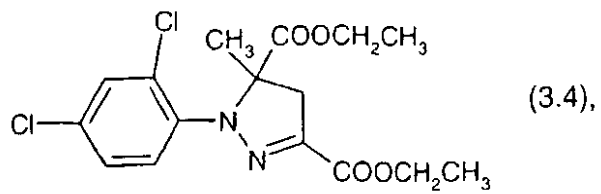
【化 9】



10

、並びに、その遊離酸及び塩、
及び、式3.4の化合物

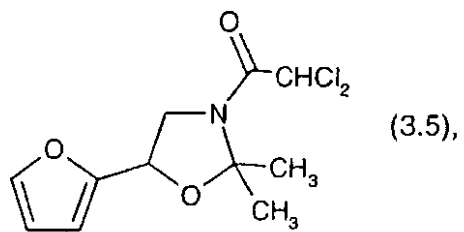
【化 1 0】



20

、並びに、その遊離酸及び塩、
及び、式3.5の化合物、

【化 1 1】

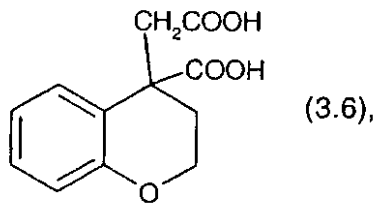


30

40

及び式3.6の化合物

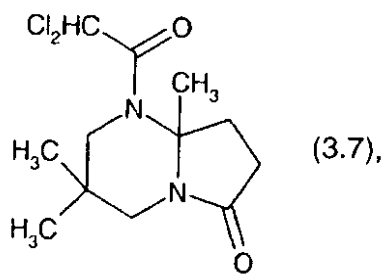
【化 1 2】



10

及び、式3.7の化合物

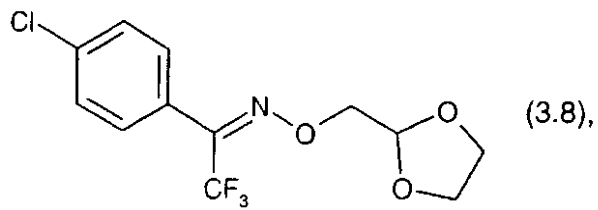
【化 1 3】



20

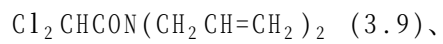
及び、式3.8の化合物

【化 1 4】



30

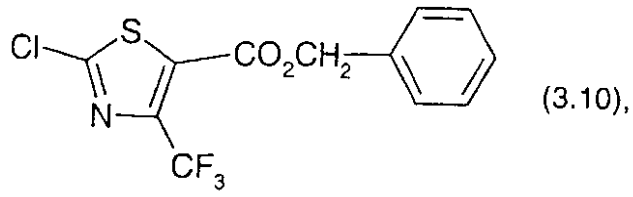
及び、式3.9の化合物



及び、式3.10の化合物

40

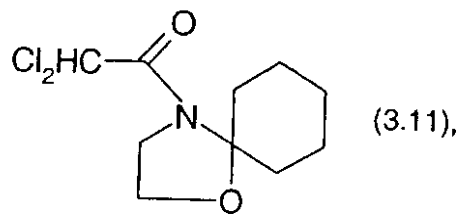
【化 1 5】



10

及び、式3.11の化合物

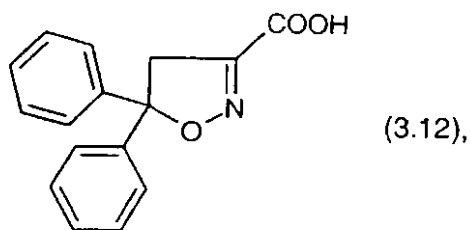
【化 1 6】



20

及び、式3.12の化合物

【化 1 7】

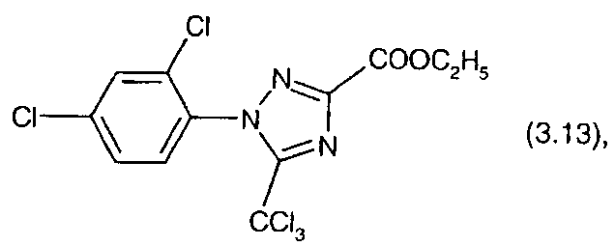


30

、及びそのエチルエステル、

及び、式3.13の化合物

【化 1 8】

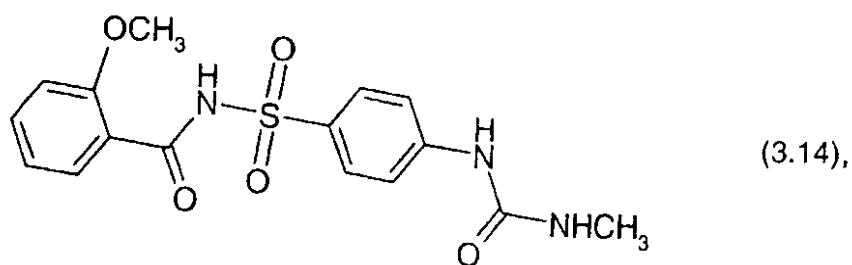


40

50

及び、式3.14の化合物

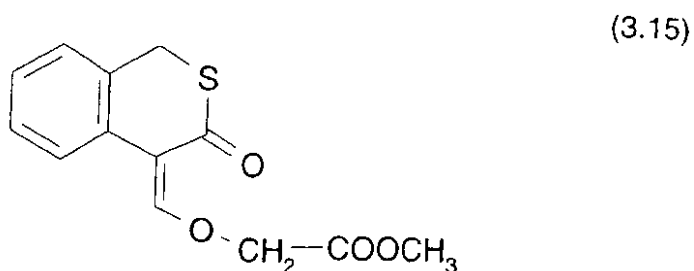
【化19】



10

及び、式3.15の化合物

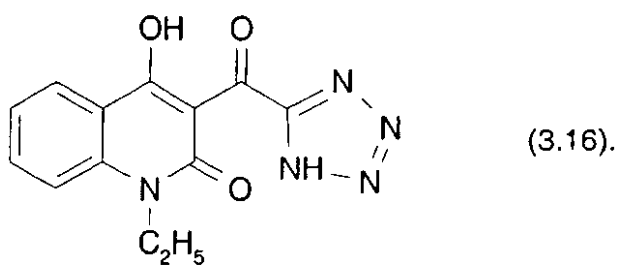
【化20】



20

及び、式3.16の化合物

【化21】



40

。

【0059】

式3.1から3.16の化合物は、公知であり、並びに、例えば、「Pesticide Manual」、第12版、British Crop Protection Council、2000年に、登録番号65(式3.1、ベノキサコール)、325(式3.2、フェンクロリム)、163(式3.3、クロキントセットメキシル)、492(式3.4、メフェンピル-ジエチル)、401(式3.5、フリラゾール)、389(式3.8、フルクソフェニム(fluxofenim))、225(式3.9、ジクロロミド)及び376(式3.10、フルラゾール(flurazole))とし

50

て説明されている。式3.11の化合物は、呼称MON 4660(Monsanto社)として公知であり、及び例えば、欧州特許公開0 436 483号に開示されている。

【0060】

クロキントセットメキシル(式3.3)の遊離酸及び塩は、例えば、国際公開公報第02/34048号において開示されており、及びメフェンピル-ジェチル(式3.4)の遊離酸及び塩は、例えば、国際公開公報第01/17353号に開示されている。

【0061】

式3.6(AC 304415)の化合物は、例えば、欧州特許公開第0 613 618号に開示され、及び式3.7の化合物は独国特許公開第29 48 535号に開示されている。式3.12の化合物は、一般名イソキサジフェン及びイソキサジフェン-エチルで知られており、及び独国特許公開第4 3 31 448号に開示され、及びCAS登録番号[209866-92-2]及び[163520-33-0]で登録されており、並びに式3.13の化合物は、独国特許公開第35 25 205号に開示されている。式3.14の化合物は、例えば、米国特許第5 215 570号に、及び式3.15の化合物は欧州特許公開第0 929 543号に開示されている。式3.16の化合物は、国際公開公報第99/00020号に開示されている。式3.16の化合物に加え、他の3-(5-テトラゾリル-カルボニル)-2-キノロンは、国際公開公報第99/00020号に開示されており、特に21~29頁の表1及び2に詳細に説明された化合物も、式Iの化合物の植物毒性作用に対し農作物植物を保護することに適している。

【0062】

本発明は、担体、溶媒及び展着剤のような、通例の不活性製剤補助剤を含有することに加え、活性成分として、a)除草剤として有効量の式Iの化合物、及びc)除草剤拮抗作用として有効量の、式3.1、3.2、3.3、3.4、3.5、3.6、3.7、3.8、3.9、3.10、3.11、3.12、3.13、3.14、3.15及び3.16の化合物から選択された化合物の混合物を含有する選択的な除草剤組成物にも関する。

【0063】

本発明の好ましい混合物は、毒性緩和剤として式3.1、3.3及び3.8の化合物から選択された化合物を含有する。このような毒性緩和剤は、特に前述の好ましいb)に列記された補助除草剤を含有する本発明のそのような組成物に適している。

【0064】

式Iの化合物の、式3.3の化合物との組合せは、非常に特別に有効な組成物であることが分かっている。このような組成物は、クロジナホップ-プロパルギル(156)と共に使用されることが好ましい。

【0065】

本発明は、有用植物の農作物における雑草の選択的防除のための方法にも関し、これは、有用植物、それらの種子もしくは挿し木、又はそれらの耕作領域を、式Iの除草剤の除草有効量、任意にb)に列記された補助除草剤から選択された1種又は複数の除草剤を含む、並びに式3.1から3.16の毒性緩和剤の除草剤拮抗作用によって有効な量で処理することを含む。

【0066】

農作物植物は、前述の除草剤の損傷作用に対し、式3.1から3.16の毒性緩和剤により保護することができるので、綿花、ダイズ、テンサイ、サトウキビ、農園作物、ナタネ、及び非常に特別には穀物、コメ及びトウモロコシが特に考慮される。「農作物」は、育種又は遺伝子工学の従来の方法の結果として、除草剤又は除草剤群に耐性を生じているそのような農作物を意味すると理解されるべきである。

【0067】

防除されるべき雑草は、単子葉及び双子葉の両雑草であり、例えば、ハコベ、ヌカボ、メヒシバ、カラスムギ、セイヨウヌカボ(Apera)、ブリタンサ(Brachiararia)、クサヨシ(Phalaris)、エノコログサ、シーンス、ボウムギ、イヌホオズキ、イヌビエ、ホタルイ、ミズアオイ、オモダカ、キビ(Panicum)、チャヒキ、スズメノテッポウ、セイバンモロコシ、ハウキモロコシ、ツノアイアシ、カヤツリグサ、イチビ、アメリカキンゴジカ、オナモミ、ヒユ、アカザ、ヒルガオ、フランスギク、ヤエムグラ、スミレ及びムシタサがある。

【0068】

耕作領域は、農作物植物が既に生育しているか又はそれらの農作物植物の種子材料が蒔かれている地面の領域に加え、そのような農作物植物の耕作が意図されている地面を含む。

【0069】

意図された用途に応じて、式3.1から3.16の毒性緩和剤は、農作物植物の種子材料の前処理において使用することもでき(種子又は挿し木の粉衣)、又は播種の前後に土壌へ導入することができる。しかしこれは、植物の出芽後に、単独で(いわゆる「分施散布(split application)」)又は除草剤と一緒にいずれかで、散布することができる。従って、植物又は種子の毒性緩和剤による処理は、原則として、除草剤が散布される時点で独立して実行されるが、多少なりとも除草剤及び毒性緩和剤が依然毒性緩和作用が逐次生じる目的で集まることができる期間も含意している。いわゆる「分施散布」は、個別の散布とは区別されなければならない。しかし植物は、除草剤及び毒性緩和剤の同時散布により処理することもできる(例えば、タンク混合物の形で)。毒性緩和剤の散布率の除草剤の散布率に対する比は、散布法に大きく依存する。毒性緩和剤及び除草剤の組合せを含有するタンク混合物を用いるか、又は毒性緩和剤及び除草剤の個別散布かによる、圃場処理の場合、除草剤の毒性緩和剤に対する比は、一般に100:1~1:10、好ましくは20:1~1:1である。圃場処理の場合、通常、1ha当り毒性緩和剤0.001~1.0kg、好ましくは1ha当り毒性緩和剤0.001~0.25kgで散布される。

【0070】

除草剤の散布率は、一般に1ha当り0.001~2kgであるが、好ましくは0.005~0.5kgである。

【0071】

本発明の組成物は、例えば、出芽前散布、出芽後散布及び種子粉衣のような、農業において通常使用される全ての散布法に適している。

【0072】

種子粉衣の場合、一般に種子1kg当り毒性緩和剤0.001~10g、好ましくは種子1kg当り毒性緩和剤0.05~2gが散布される。毒性緩和剤が、種子の浸漬により、液体の形で播種の少し前に散布される場合、その後有利なことに使用した毒性緩和剤溶液は、活性成分を、濃度1~10000ppm、好ましくは100~1000ppmで含むことができる。

【0073】

散布を目的として、式3.1から3.16の毒性緩和剤、又はそれらの毒性緩和剤の式Iの除草剤及び任意にb)に列記された補助除草剤から選択された1種又は複数の除草剤との組合せは、有利なことに、製剤技術において通例の補助剤と共に、例えば乳化可能な濃縮物、被覆可能なパスタ剤、直接噴霧可能な又は希釈可能な液剤、希釈乳剤、水和散剤、可溶性散剤、粉剤、顆粒剤又はマイクロカプセル剤へ製剤される。

【0074】

このような製剤は、例えば、国際公開公報第97/34485号、9~13頁に記されている。これらの製剤は、例えば、活性成分の溶媒もしくは固形担体などの液体又は固形製剤補助剤との均質混合及び／又は粉碎のような、公知の方法で調製される。加えて、表面-活性化化合物(界面活性剤)を、この製剤の調製において使用することもできる。この目的に適した溶媒及び固形担体は、例えば、国際公開公報第97/34485号、6頁に言及されている。

【0075】

製剤される式Iの化合物、b)に列記された補助除草剤及び式3.1から3.16の毒性緩和剤の性質に応じ、表面-活性化化合物として、良好な乳化、分散及び湿潤特性を有する、非イオン性、カチオン性及び／又はアニオン性界面活性剤並びに界面活性剤混合物が考慮される。適当なアニオン性、非イオン性及びカチオン性界面活性剤の例が、例えば国際公開公報第97/34485号の7及び8頁に列記されている。同じく本発明の除草組成物の調製に適しているのは、製剤技術において通常使用される界面活性剤であり、これは特に、「McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual」、MC Publishing社、リッジウッド、NJ、1981

年、Stache, H.、「Tensid-Taschenbuch」、Carl Hanser Verlag社、ミュンヘン／ウィーン、1981年、並びにM.及びJ. Ash、「Encyclopedia of Surfactants」、I-III巻、Chemical Publishing社、ニューヨーク、1980-81年に説明されている。

【0076】

除草剤は通常、式Iの化合物、b)に列記された補助除草剤から選択された化合物及び式3.1から3.16の毒性緩和剤を含有する0.1～99重量%、特に0.1～95重量%の活性成分混合物、1～99.9重量%の固形もしくは液体製剤補助剤、並びに0～25重量%、特に0.1～25重量%の界面活性剤を含有する。商業的製品は通常濃縮物として製剤されることが好ましいが、最終使用者は、一般に希釈製剤を使用する。

【0077】

これらの組成物は、更なる成分、安定剤、例えば植物油又はエポキシ化された植物油(エポキシ化されたココナッツ油、ナタネ油又はダイズ油)など、泡消剤、例えばシリコーン油など、保存剤、粘度調節剤、結合剤、増粘剤、及び肥料又は他の活性成分を含有してもよい。式Iの除草剤及びb)に列記された補助除草剤の損傷作用に対し農作物植物を保護することにおいて、式3.1から3.16の毒性緩和剤、又はこれらを含有する組成物の使用のために、様々な方法及び技術が、例えば下記のように、考慮される：

【0078】

i) 種子粉衣

a) 種子表面上に均一に分散するまで容器内で振盪することによる、種子への、式3.1から3.16の化合物の水和散剤の製剤の粉衣(乾燥粉衣)。その手法において、種子材料100kg当り式3.1から3.16の化合物約1～500g(水和散剤4g～2kg)を使用する。

b) 方法a)に従う、種子への、式3.1から3.16の化合物の乳化可能な濃縮物の粉衣(湿潤粉衣)。

c) 種子材料の、式3.1から3.16の化合物100～1000ppm含有する液体中の、1～72時間の含浸、及び任意に引き続きの種子の乾燥による粉衣(含浸粉衣)。

【0079】

種子材料の粉衣又は発芽した実生苗の処理は、本来好ましい散布法であり、その理由は、この活性成分による処理が、完全に標的農作物に向けられるからである。一般に、解毒剤1～1000g、好ましくは解毒剤5～250gが、種子材料100kg当りに使用されるが、他の活性成分又は微量栄養素の添加を可能にもする方法に応じて、示された限界以上又は未満の濃縮物を使用することができる(反復粉衣)。

【0080】

ii) タンク混合物としての適用

解毒剤及び除草剤の混合物の液体製剤が使用され(一方の他方に対する重量比10:1から1:100)、除草剤の散布率は1ha当り0.005～5.0kgである。このようなタンク混合物は、播種の前後に散布される。

【0081】

iii) 作条への散布

式3.1から3.16の化合物は、乳化可能な濃縮物、水和散剤又は顆粒剤の形で、開放の播種された作条へ導入される。一旦作条が覆われたならば、除草剤は、通常の方法で出芽前に散布される。

【0082】

iv) 活性成分の緩効

式3.1から3.16の化合物は、溶液中で、無機担体の顆粒剤、もしくは重合された顆粒剤(尿素／ホルムアルデヒド)へ塗布され、及び乾燥される。望ましいならば、一定の期間、活性成分を測定された量で放出するコーティングを塗布することも可能である(コートされた顆粒剤)。

【0083】

好ましい製剤は、特に下記の組成物である：(% = 重量%)

【0084】

10

20

30

40

50

乳化可能な濃縮物：

活性成分混合物：1～90%、好ましくは5～20%

界面活性剤：1～30%、好ましくは10～20%

液体担体：5～94%、好ましくは70～85%

粉剤：

活性成分混合物：0.1～10%、好ましくは0.1～5%

固形担体：99.9～90%、好ましくは99.9～99%。

懸濁剤濃縮物：

活性成分混合物：5～75%、好ましくは10～50%

水：94～24%、好ましくは88～30%

界面活性剤：1～40%、好ましくは2～30%

水和散剤：

活性成分混合物：0.5～90%、好ましくは1～80%

界面活性剤：0.5～20%、好ましくは1～15%

固形担体：5～95%、好ましくは15～90%

顆粒剤：

活性成分混合物：0.1～30%、好ましくは0.1～15%

固形担体：99.5～70%、好ましくは97～85%

【0085】

下記実施例は、本発明を例証しているが、本発明を限定するものではない。

【0086】

式Iの除草剤の、任意に補助除草剤b)、及び式3.1から3.16の毒性緩和剤の混合物の製剤例
(% = 重量%)

【表9】**F1. 乳化可能な濃縮物**

	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	5%	10%	25%	50%
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	6%	8%	6%	8%
ポリグリコールエーテルひまし油 (エチレンオキシド36mol)	4%	—	4%	4%
オクチルフェノールポリグリコールエーテル (エチレンオキシド7-8mol)	—	4%	—	2%
シクロヘキサノン	—	—	10%	20%
芳香族炭化水素混合物C ₉ -C ₁₂	85%	78%	55%	16%

任意な望ましい濃度の乳剤は、水による希釈によりそのような濃縮物から得ることができる。

【0087】

10

20

30

40

【表 1 0】

F2. 液剤

	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	5%	10%	50%	90%
1-メトキシ-3-(3-メトキシ-プロポキシ)-プロパン	—	20%	20%	—
ポリエチレングリコールMW400	20%	10%	—	—
N-メチル-2-ピロリドン	—	—	30%	10%
芳香族炭化水素混合物C ₉ -C ₁₂	75%	60%	—	—

10

これらの溶液は、微小液滴の形での使用に適している。

【0 0 8 8】

【表 1 1】

20

F3. 水和散剤

	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	5%	25%	50%	80%
リグノスルホン酸ナトリウム	4%	—	3%	—
ラウリル硫酸ナトリウム	2%	3%	—	4%
ジイソブチルナフタレン-スルホン酸ナトリウム	—	6%	5%	6%
オクチルフェノールポリグリコールエーテル (エチレンオキシド7-8mol)	—	1%	2%	—
高度に分散されたケイ酸	1%	3%	5%	10%
カオリン	88%	62%	35%	—

30

活性成分は、補助剤と共に十分に混合され、及びこの混合物は、適当なミルにおいて完全に粉碎され、所望の濃度の懸濁剤を生じるように、水で希釈することができる水和散剤をもたらす。

【0 0 8 9】

【表 1 2】

F4. コート顆粒剤

	a)	b)	c)
活性成分混合物	0.1%	5%	15%
高度に分散されたケイ酸	0.9%	2%	2%
無機担体(直径0.1-1mm)、例えばCaCO ₃ 又はSiO ₂	99.0%	93%	83%

10

活性成分を、塩化メチレンに溶解し、そして噴霧により担体に塗布し、次に溶媒を真空除去する。

【0090】

【表 1 3】

20

F5. コート顆粒剤

	a)	b)	c)
活性成分混合物	0.1%	5%	15%
ポリエチレングリコールMW200	1.0%	2%	3%
高度に分散されたケイ酸	0.9%	1%	2%
無機担体(直径0.1-1mm)、例えばCaCO ₃ 又はSiO ₂	98.0%	92%	80%

30

細かく粉碎した活性成分を、ポリエチレングリコールで加湿した担体に、ミキサー中で均質に塗布した。粉状でないコートされた顆粒剤をこの方法で得た。

【0091】

【表 1 4】

F6. 押出顆粒剤

	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	0.1%	3%	5%	15%
リグノスルホン酸ナトリウム	1.5%	2%	3%	4%
カルボキシメチルセルロース	1.4%	2%	2%	2%
カオリン	97.0%	93%	90%	79%

40

活性成分を、混合し、補助剤と共に粉碎し、そしてこの混合物を、水で加湿する。この混合物を押出し、その後空気流れ中で乾燥する。

50

【0092】

【表15】

F7. 粉剤

	a)	b)	c)
活性成分混合物	0.1%	1%	5%
タルク	39.9%	49%	35%
カオリン	60.0%	50%	60%

10

用時調製用粉剤は、活性成分を、担体と混合し、そして適当なミル中で混合物を粉碎することにより得られる。

【0093】

【表16】

20

F8. 懸濁剤濃縮物

	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	3%	10%	25%	50%
エチレングリコール	5%	5%	5%	5%
ノニルフェノールポリグリコールエーテル (エチレンオキシド15mol)	—	1%	2%	—
リグノスルホン酸ナトリウム	3%	3%	4%	5%
カルボキシメチルセルロース	1%	1%	1%	1%
37%ホルムアルデヒド水溶液	0.2%	0.2%	0.2%	0.2%
シリコーン油乳剤	0.8%	0.8%	0.8%	0.8%
水	87%	79%	62%	38%

30

細かく粉碎した活性成分を、補助剤と均質混合し、懸濁剤濃縮物を得、これから任意な所望の濃度の懸濁剤を、水で希釈することにより得た。

【0094】

40

式Iの化合物、b)に列記された補助除草剤及び式3.1から3.16の毒性緩和剤が、個別に製剤され、その後散布直前に水と一緒に「タンク混合」の形で塗布具中に所望の混合比で投入されることがより多くの実践であることが多い。

【0095】

式3.1から3.16の毒性緩和剤の農作物植物を式Iの除草剤の植物毒性作用に対し保護する能力は、下記実施例において説明されている。

【0096】

生物学の実施例：毒性緩和作用

被験植物は、温室条件下でプラスチック製ポット内で4枚葉期まで生育した。この段階で、除草剤単独又は除草剤の毒性緩和剤として試験される被験化合物との混合物のいずれ

50

かが、被験植物に散布される。被験化合物は、1ヘクタールあたり500Lを用い、25%水和散剤から調製した水性懸濁剤の形で散布され(実施例F3、b))、散布の4週間後に、除草剤の農作物植物、例えば、トウモロコシ及び穀物に対する植物毒性を、百分率スケールを用いて評価した。100%は、被験植物が枯死したことを示し、0%は植物毒性が無いことを示す。本発明の混合物は、この試験において良好な作用を示している。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International Application No. PCT/EP 03/03471
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 7 A01N43/40		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 7 A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) PAJ, EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 11 147866 A (SANKYO CO LTD) 2 June 1999 (1999-06-02) & PATENT ABSTRACTS OF JAPAN & JP 11 147866 A (SANKYO CO LTD), 2 June 1999 (1999-06-02) page 10	1-10
P,A	WO 02 28182 A (HALL ROGER GRAHAM ;SCHAETZER JUERGEN (CH); EBERLE MARTIN (CH); REN) 11 April 2002 (2002-04-11) cited in the application the whole document	1-10
☐ Further documents are listed in the continuation of box C. ☒ Patent family members are listed in annex.		
* Special categories of cited documents : *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance *E* earlier document but published on or after the international filing date *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art. *&* document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 24 June 2003		Date of mailing of the international search report 01/07/2003
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Molina de Alba, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 03/03471

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
JP 11147866	A	02-06-1999	NONE	
WO 0228182	A	11-04-2002	AU 1820002 A WO 0228182 A1	15-04-2002 11-04-2002

フロントページの続き

(51)Int.Cl. ⁷	F I	テーマコード (参考)
A O 1 N 37/40	A O 1 N 37/22	1 0 1
A O 1 N 39/02	A O 1 N 37/34	1 0 6
A O 1 N 41/10	A O 1 N 37/40	
A O 1 N 43/12	A O 1 N 39/02	D
A O 1 N 43/18	A O 1 N 41/10	A
A O 1 N 43/20	A O 1 N 43/12	A
A O 1 N 43/42	A O 1 N 43/18	Z
A O 1 N 43/50	A O 1 N 43/20	
A O 1 N 43/56	A O 1 N 43/42	1 0 1
A O 1 N 43/58	A O 1 N 43/50	Q
A O 1 N 43/70	A O 1 N 43/56	C
A O 1 N 43/76	A O 1 N 43/56	E
A O 1 N 43/78	A O 1 N 43/58	A
A O 1 N 43/80	A O 1 N 43/70	
A O 1 N 43/824	A O 1 N 43/76	1 0 1
A O 1 N 43/88	A O 1 N 43/78	A
A O 1 N 43/90	A O 1 N 43/78	Z
A O 1 N 47/16	A O 1 N 43/78	1 0 1
A O 1 N 47/30	A O 1 N 43/80	1 0 1
A O 1 N 47/36	A O 1 N 43/88	1 0 5
A O 1 N 47/38	A O 1 N 43/90	1 0 5
	A O 1 N 47/16	B
	A O 1 N 47/30	B
	A O 1 N 47/30	C
	A O 1 N 47/36	1 0 1 B
	A O 1 N 47/36	1 0 1 E
	A O 1 N 47/38	A
	A O 1 N 43/82	1 0 1 B
	A O 1 N 43/82	1 0 1 E

(81)指定国 AP(GH,GM,KE,LS,MW,MZ,SD,SL,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,MD,RU,TJ,TM),EP(AT, BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HU,IE,IT,LU,MC,NL,PT,RO,SE,SI,SK,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA, GN,GQ,GW,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BR,BY,BZ,CA,CH,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DZ, EC,EE,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,HR,HU,ID,IL,IN,IS,JP,KE,KG,KP,KR,KZ,LC,LK,LR,LS,LT,LU,LV,MA,MD,MG,MK,MN,M W,MX,MZ,NO,NZ,OM,PH,PL,PT,RO,RU,SC,SD,SE,SG,SK,SL,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,YU,ZA,ZM,ZW

- (72)発明者 シェッツァー, ユルゲン
 スイス国, ツェーハー—4 0 5 8 バーゼル, シュバルツバルトアレー 2 1 5, シンジエンタ
 クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト
- (72)発明者 ベンガー, ジャン
 スイス国, ツェーハー—4 0 5 8 バーゼル, シュバルツバルトアレー 2 1 5, シンジエンタ
 クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト
- (72)発明者 ホール, ロジャー グラハム
 スイス国, ツェーハー—4 0 5 8 バーゼル, シュバルツバルトアレー 2 1 5, シンジエンタ
 クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト
- (72)発明者 ネーベル, クルト
 スイス国, ツェーハー—4 0 5 8 バーゼル, シュバルツバルトアレー 2 1 5, シンジエンタ

クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト

(72)発明者 ホール, スティーブン

スイス国, ツェーハー 4 3 3 2 シュタイン, シャフハウザーシュトラッセ, ベルク シュタイン, シンジェンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト

(72)発明者 ストラー, アンドレ

スイス国, ツェーハー 4 0 5 8 バーゼル, シュバルツバルトアレー 2 1 5, シンジェンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト

F ターム(参考) 4H011 AB01 BA01 BA03 BA06 BB05 BB06 BB07 BB08 BB09 BB10
BB13 BB14 BC01 BC03 BC05 BC07 BC08 BC09 BC10 BC14
BC16 BC18 BC19 BC20 DA02 DA13 DA15 DA16 DC01 DC02
DC05 DC06 DC08 DC10 DD03 DF04 DF05 DH03 DH10