

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第6062528号

(P6062528)

(45) 発行日 平成29年1月18日 (2017. 1. 18)

(24) 登録日 平成28年12月22日 (2016. 12. 22)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 239/47 (2006. 01)

C O 7 D 239/47

C S P Z

C O 7 D 405/12 (2006. 01)

C O 7 D 405/12

A O 1 N 43/54 (2006. 01)

A O 1 N 43/54

C

A O 1 P 13/00 (2006. 01)

A O 1 P 13/00

請求項の数 14 (全 67 頁)

(21) 出願番号 特願2015-502318 (P2015-502318)
 (86) (22) 出願日 平成25年3月27日 (2013. 3. 27)
 (65) 公表番号 特表2015-516383 (P2015-516383A)
 (43) 公表日 平成27年6月11日 (2015. 6. 11)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2013/056483
 (87) 国際公開番号 W02013/144187
 (87) 国際公開日 平成25年10月3日 (2013. 10. 3)
 審査請求日 平成27年10月2日 (2015. 10. 2)
 (31) 優先権主張番号 12162187.4
 (32) 優先日 平成24年3月29日 (2012. 3. 29)
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)

(73) 特許権者 512137348
 バイエル・インテレクチュアル・プロパティ・ゲゼルシャフト・ミット・ベシュレンクテル・ハフツング
 Bayer Intellectual Property GmbH
 ドイツ40789モンハイム・アム・ライン、アルフレート・ノーベル・シュトラッセ10番
 (74) 代理人 100114188
 弁理士 小野 誠
 (74) 代理人 100119253
 弁理士 金山 賢教
 (74) 代理人 100124855
 弁理士 坪倉 道明

最終頁に続く

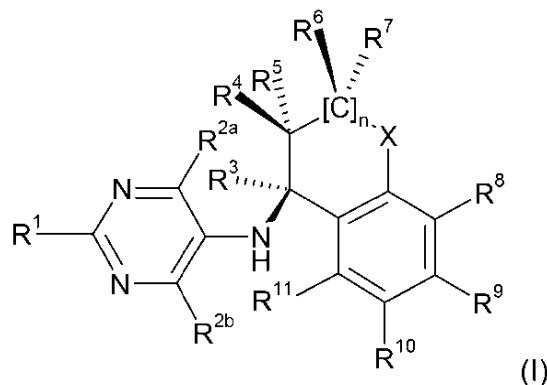
(54) 【発明の名称】 5-アミノピリミジン誘導体及び望ましくない植物の成長を防除するためのそれらの使用

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (I)

【化 1】



(I)

〔式中、

R¹ は、SO₂CH₃であり；及び、

R^{2a} 及び R^{2b} は、それぞれ、互いに独立して、水素、シアノ、C(O)OH、C(O)NH₂、COOCH₃、CONHCH₃ 及び CONHシクロプロピル からなる群から選択され；及び、

R^3 は、水素であり；及び、

R^4 及び R^5 は、それぞれ、互いに独立して、水素及び $(C_1 - C_6)$ - アルキル からなる群から選択され；又は、ラジカル R^4 とラジカル R^5 は、それらが結合している炭素原子と一緒に、3員～7員の環を形成しており；及び、

R^6 及び R^7 は、水素であり；及び、

R^8 は、それぞれ、互いに独立して、水素、フッ素及び $(C_1 - C_6)$ - アルキル からなる群から選択され；及び

R^9 は、それぞれ、互いに独立して、水素、塩素及び $(C_1 - C_6)$ - アルキル からなる群から選択され；及び

R^{10} は、それぞれ、互いに独立して、水素及び $(C_1 - C_6)$ - アルキル からなる群から選択され；及び

R^{11} は、それぞれ、互いに独立して、水素及び $(C_1 - C_6)$ - アルキル からなる群から選択され；及び

X は、結合、 CH_2 又は O であり；及び、

n は、X が結合であるときは、連続する数 1 又は 2 であり、X が CH_2 又は O であるときは、連続する数 0 又は 1 である

で表される化合物又はその農薬的に許容される塩。

【請求項 2】

ラジカル R^4 及び R^5 が、それぞれ、互いに独立して、水素及びメチル からなる群から選択されることを特徴とする、請求項 1 に記載の一般式 (I) で表される化合物。

【請求項 3】

ラジカル R^8 が、水素、フッ素及び CH_3 からなる群から選択されることを特徴とする、請求項 1 又は 2 に記載の一般式 (I) で表される化合物。

【請求項 4】

ラジカル R^9 が、水素、塩素及びメチル からなる群から選択されることを特徴とする、請求項 1 ～ 3 のいずれかに記載の一般式 (I) で表される化合物。

【請求項 5】

ラジカル R^{10} が、水素、メチル (CH_3) 及びエチル (CH_2CH_3) からなる群から選択されることを特徴とする、請求項 1 ～ 4 のいずれかに記載の一般式 (I) で表される化合物。

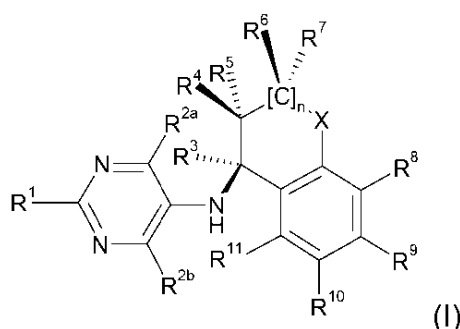
【請求項 6】

ラジカル R^{11} が、水素である ことを特徴とする、請求項 1 ～ 5 のいずれかに記載の一般式 (I) で表される化合物。

【請求項 7】

一般式 (I)

【化 2】



〔式中、ラジカル $R^1 \sim R^{11}$ 及び X、並びに、さらに、n は、請求項 1 ～ 6 のいずれかで定義されているとおりである〕

で表される化合物及び／又はその農薬的に許容される塩及び／又はその農薬的に許容される 4 級化された窒素誘導体を調製する方法であって、一般式 (I I)

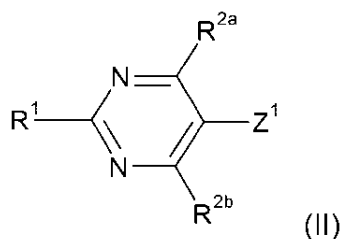
10

20

30

40

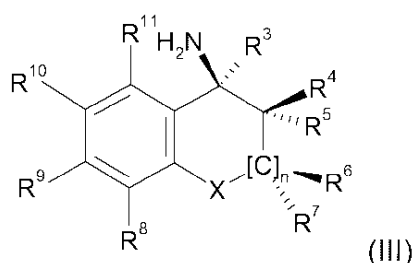
【化 3】



〔式中、 R^1 及び R^{2a} 及びさらに R^{2b} は、請求項 1 ～ 6 のいずれかで定義されているとおりであり、並びに、 Z^1 は、交換可能なラジカル又は脱離基である〕
で表される化合物を一般式 (III)

10

【化 4】



20

〔式中、ラジカル $R^3 \sim R^{11}$ 及び X 、並びに、さらに、 n は、上記意味を有する〕
で表されるアミン又は一般式 (III) で表されるアミンの酸付加塩と反応させる、前記調製方法。

【請求項 8】

前記交換可能なラジカル Z^1 又は脱離基 Z^1 が、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 $(C_1 \sim C_4)$ -アルキルスルホニル、置換されていないか若しくは置換されているフェニル- $(C_1 \sim C_4)$ -アルキルスルホニル又は $(C_1 \sim C_4)$ -アルキルフェニルスルホニルである、請求項 7 に記載の調製方法。

【請求項 9】

除草性組成物又は植物成長調節性組成物であって、請求項 1 ～ 6 のいずれかに記載されている一般式 (I) で表される 1 種類以上の化合物又はその塩を含んでいることを特徴とする、前記組成物。

30

【請求項 10】

有害な植物を防除する方法又は植物の成長を調節する方法であって、有効量の請求項 1 ～ 6 のいずれかに記載されている一般式 (I) で表される 1 種類以上の化合物又はその塩を、植物、植物の部分、植物の種子又は耕作されている領域に施用することを特徴とする、前記方法。

【請求項 11】

除草剤又は植物成長調節剤としての、請求項 1 ～ 6 のいずれかに記載されている一般式 (I) で表される化合物又はその塩の使用。

40

【請求項 12】

一般式 (I) で表される化合物又はその塩が、有用な植物の作物又は観賞植物の中の有害な植物を防除するために又は植物の成長を調節するために、使用されることを特徴とする、請求項 11 に記載の使用。

【請求項 13】

前記作物植物がトランスジェニック作物植物であることを特徴とする、請求項 12 に記載の使用。

【請求項 14】

前記作物植物がプランテーション作物から選択されることを特徴とする、請求項 11 又は 12 に記載の使用。

50

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、作物保護組成物の技術分野に関し、特に、有用な植物の作物の中の及び観賞庭園の中の広葉雑草及びイネ科雑草を選択的に防除するための除草剤の技術分野、並びに、植物の成長が破壊的である様な環境の領域内の広葉雑草及びイネ科雑草を全体的に防除するための除草剤の技術分野に関する。

【0002】

特に、本発明は、置換されている5-アミノピリミジン類、それらを調製する方法及び有害な植物を防除するためのそれらの使用に関する。

10

【背景技術】

【0003】

除草作用を示すジアミノピリミジン類は、従来技術から知られている。かくして、2, 4-ジアミノピリミジン類及び作物保護の分野におけるそれらの使用については、例えば、文献EP 0523533 A1、WO 2010/076009及びWO 2010/076010によって開示されている。

【0004】

しかしながら、このタイプの誘導体を有用な植物のさまざまな作物の中で有害な植物を防除するための選択的除草剤として使用すること又は植物成長調節剤として使用することは、多くの場合、高コストを伴う施用量を必要とするか、又は、有用な植物に対して望ましくない損傷を引き起こす。さらに、多くの場合、そのような活性化合物を使用することは、比較的高い製造コストに起因して、非経済的である。

20

【0005】

従って、除草剤又は植物成長調節剤として使用することが可能で、従来技術から知られているシステムと比較して特定の有利点を有しているような、ピリミジン誘導体に基づく代替的な化学活性化合物を提供することは望ましい。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0006】

【特許文献1】欧州特許出願公開第0523533 A1号

30

【特許文献2】国際特許出願公開第2010/076009号

【特許文献3】国際特許出願公開第2010/076010号

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0007】

本発明の目的は、有害植物に対する十分な除草作用及び広い活性スペクトルを有し並びに／又は有用な植物の作物の中で高い選択性を有している除草剤又は植物成長調節剤として使用することが可能な代替的なピリミジン誘導体を提供することである。

【0008】

従来技術から知られているピリミジン誘導体と比較して、これらのピリミジン誘導体は、より優れた特性プロファイル（特に、有害植物に対するより優れた除草活性）を示すべきであり、より広い範囲の有害植物を対象とすべきであり、及び／又は、有用な植物の作物の中でより高い選択性を有しているべきである。

40

【課題を解決するための手段】

【0009】

本発明によって、本発明者らは、除草剤及び植物成長調節剤として有利に使用することが可能な式(I)で表される特定の置換された5-アミノピリミジンを見いだした。

【0010】

本発明による式(I)で表される化合物は、そのピリミジンの5位に、芳香族環のα位においてアミンを介して結合している部分的に水素化された二環式置換基を有している。

50

【0011】

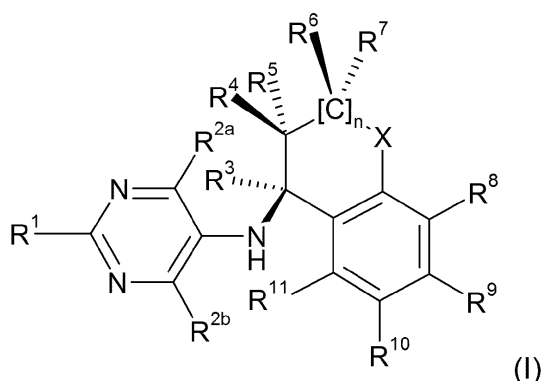
本発明による式 (I) で表される 5-アミノピリジン誘導体は、アミノ基の位置及び数の点で、2, 4-ジアミノピリミジン構造を有している既知除草剤とは異なっている。本発明による 5-アミノピリミジンは、ただ 1つのアミノ基で置換されていることを特徴とし、ここで、該アミノ基は、二環式ラジカルで置換されていて、ピリミジンの 5 位に位置している

かくして、式 (I) で表される化合物におけるラジカル R^1 、ラジカル R^{2a} 及びラジカル R^{2b} は、アミノ基を表さない。即ち、 R^1 、 R^{2a} 及び R^{2b} は、ピリミジンに窒素を介して結合することはない。しかしながら、ラジカル R^1 、ラジカル R^{2a} 及びラジカル R^{2b} は、それでも、アミノ基又はアミド基（例えば、アミノカルボニル— ($C_1 - C_6$) —アルキル、ジ— ($C_1 - C_6$) —アルキルアミノカルボニル— ($C_1 - C_6$) —アルキル) を含むことができる。

【0012】

本発明は、式 (I)

【化 1】



【0013】

〔式中、

R^1 は、

- ・ シアノ、ニトロ、 $C(O)OH$ 、 $C(O)NH_2$ ；
- ・ ($C_1 - C_6$) —アルキル、($C_1 - C_6$) —ハロアルキル、($C_1 - C_6$) —アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) —ハロアルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) —アルキルカルボニルオキシ、($C_1 - C_6$) —ハロアルキルカルボニルオキシ、($C_1 - C_6$) —アルキルカルボニル— ($C_1 - C_4$) —アルキル；
- ・ ($C_1 - C_6$) —アルコキシ、($C_1 - C_6$) —ハロアルコキシ、($C_1 - C_6$) —アルコキシカルボニル、($C_1 - C_6$) —ハロアルコキシカルボニル、($C_1 - C_6$) —アルコキシカルボニル— ($C_1 - C_6$) —アルキル、($C_1 - C_6$) —ハロアルコキシカルボニル— ($C_1 - C_6$) —アルキル、($C_1 - C_6$) —アルコキシカルボニル— ($C_1 - C_6$) —ハロアルキル、($C_1 - C_6$) —ハロアルコキシカルボニル— ($C_1 - C_6$) —ハロアルキル；
- ・ ($C_2 - C_6$) —アルケニル、($C_2 - C_6$) —ハロアルケニル、($C_2 - C_6$) —アルケニルカルボニル、($C_2 - C_6$) —ハロアルケニルカルボニル、($C_2 - C_6$) —アルケニルオキシ、($C_2 - C_6$) —ハロアルケニルオキシ、($C_2 - C_6$) —アルケニルオキシカルボニル、($C_2 - C_6$) —ハロアルケニルオキシカルボニル；
- ・ ($C_2 - C_6$) —アルキニル、($C_2 - C_6$) —ハロアルキニル、($C_2 - C_6$) —アルキニルカルボニル、($C_2 - C_6$) —ハロアルキニルカルボニル、($C_2 - C_6$) —アルキニルオキシ、($C_2 - C_6$) —ハロアルキニルオキシ、($C_2 - C_6$) —アルキニルオキシカルボニル、($C_2 - C_6$) —ハロアルキニルオキシカルボニル；
- ・ トリ— ($C_1 - C_6$) —アルキルシリル— ($C_2 - C_6$) —アルキニル、ジ— ($C_1 - C_6$) —アルキルシリル— ($C_2 - C_6$) —アルキニル、モノ— ($C_1 - C_6$) —ア

ルキルシリル- (C_2-C_6)-アルキニル; フェニルシリル- (C_2-C_6)-アルキニル;

- ・ (C_6-C_{14})-アリール、(C_6-C_{14})-アリールオキシ、(C_6-C_{14})-アリールカルボニル及び(C_6-C_{14})-アリールオキシカルボニル(ここで、これらは、それぞれ、そのアリール部分において、ハロゲン、(C_1-C_6)-アルキル及び/又は(C_1-C_6)-ハロアルキルで置換されていてもよい);

- ・ (C_6-C_{14})-アリール- (C_1-C_6)-アルキル、(C_6-C_{14})-アリール- (C_1-C_6)-アルコキシ、(C_6-C_{14})-アリール- (C_1-C_6)-アルキル-カルボニル、(C_6-C_{14})-アリール- (C_1-C_6)-アルキル-カルボニルオキシ、(C_6-C_{14})-アリール- (C_1-C_6)-アルコキシカルボニル、(C_6-C_{14})-アリール- (C_1-C_6)-アルコキシカルボニルオキシ;

- ・ アミノカルボニル- (C_1-C_6)-アルキル、ジ- (C_1-C_6)-アルキルアミノカルボニル- (C_1-C_6)-アルキル;

- ・ モノ- (C_1-C_6)-アルキル)-アミノ-カルボニル、モノ- (C_1-C_6)-ハロアルキル)-アミノ-カルボニル、ジ- (C_1-C_6)-アルキル)-アミノ-カルボニル、ジ- (C_1-C_6)-ハロアルキル)-アミノ-カルボニル、(C_1-C_6)-アルキル- (C_1-C_6)-ハロアルキル)-アミノ-カルボニル、N- (C_1-C_6)-アルカノイル)-アミノ-カルボニル、N- (C_1-C_6)-ハロアルカノイル)-アミノ-カルボニル、モノ- (C_6-C_{14})-アリール)-アミノ-カルボニル、ジ- (C_6-C_{14})-アリール)-アミノ-カルボニル;

- ・ (C_1-C_6)-アルコキシ- (C_1-C_6)-アルキル、(C_1-C_6)-アルコキシ- (C_1-C_6)-アルコキシ、(C_1-C_6)-アルコキシカルボニル- (C_1-C_6)-アルコキシ;

- ・ (C_3-C_8)-シクロアルキル(ここで、これは、そのシクロアルキルラジカルにおいて、(C_1-C_6)-アルキル及び/又はハロゲンで置換されていてもよい)、(C_3-C_8)-シクロアルコキシ、(C_3-C_8)-シクロアルキル- (C_1-C_6)-アルキル、(C_3-C_8)-シクロアルキル- (C_1-C_6)-ハロアルキル、(C_3-C_8)-シクロアルキル- (C_1-C_6)-アルコキシ、(C_3-C_8)-シクロアルキル- (C_1-C_6)-ハロアルコキシ、(C_3-C_8)-シクロアルキルカルボニル、(C_3-C_8)-シクロアルコキシカルボニル、(C_3-C_8)-シクロアルキル- (C_1-C_6)-ハロアルキルカルボニル、(C_3-C_8)-シクロアルキル- (C_1-C_6)-アルコキシカルボニル、(C_3-C_8)-シクロアルキル- (C_1-C_6)-ハロアルコキシカルボニル、(C_3-C_8)-シクロアルキルカルボニルオキシ、(C_3-C_8)-シクロアルコキシカルボニルオキシ、(C_3-C_8)-シクロアルキル- (C_1-C_6)-アルキルカルボニルオキシ、(C_3-C_8)-シクロアルキル- (C_1-C_6)-ハロアルキルカルボニルオキシ、(C_3-C_8)-シクロアルキル- (C_1-C_6)-アルコキシカルボニルオキシ、(C_3-C_8)-シクロアルキル- (C_1-C_6)-ハロアルコキシカルボニルオキシ;

- ・ (C_3-C_8)-シクロアルケニル、(C_3-C_8)-シクロアルケニルオキシ、(C_3-C_8)-シクロアルケニル- (C_1-C_6)-アルキル、(C_3-C_8)-シクロアルケニル- (C_1-C_6)-ハロアルキル、(C_3-C_8)-シクロアルケニル- (C_1-C_6)-アルコキシ、(C_3-C_8)-シクロアルケニル- (C_1-C_6)-ハロアルコキシ、(C_3-C_8)-シクロアルケニルカルボニル、(C_3-C_8)-シクロアルケニルオキシカルボニル、(C_3-C_8)-シクロアルケニル- (C_1-C_6)-アルキルカルボニル、(C_3-C_8)-シクロアルケニル- (C_1-C_6)-ハロアルキルカルボニル、(C_3-C_8)-シクロアルケニル- (C_1-C_6)-アルコキシカルボニル、(C_3-C_8)-シクロアルケニル- (C_1-C_6)-ハロアルコキシカルボニル、(C_3-C_8)-シクロアルケニルカルボニルオキシ、(C_3-C_8)-シクロアルケニルオキシカルボニルオキシ、(C_3-C_8)-シクロアルケニル- (C_1-C_6)-アルキ

10

20

30

40

50

ルカルボニルオキシ、 (C_3-C_8) －シクロアルケニル－ (C_1-C_6) －ハロアルキルカルボニルオキシ、 (C_3-C_8) －シクロアルケニル－ (C_1-C_6) －アルコキシカルボニルオキシ、 (C_3-C_8) －シクロアルケニル－ (C_1-C_6) －ハロアルコキシカルボニルオキシ；

・ ヒドロキシ－ (C_1-C_6) －アルキル、ヒドロキシ－ (C_1-C_6) －アルコキシ、シアノ－ (C_1-C_6) －アルコキシ、シアノ－ (C_1-C_6) －アルキル；

・ (C_1-C_6) －アルキルスルホニル、 (C_1-C_6) －アルキルチオ、 (C_1-C_6) －アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) －ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_6) －ハロアルキルチオ、 (C_1-C_6) －ハロアルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) －アルキルスルホニル－ (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －アルキルチオ－ (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －アルキルスルフィニル－ (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －ハロアルキルスルホニル－ (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －ハロアルキルチオ－ (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －ハロアルキルスルフィニル－ (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －アルキルスルホニル－ (C_1-C_6) －ハロアルキル、 (C_1-C_6) －アルキルチオ－ (C_1-C_6) －ハロアルキル、 (C_1-C_6) －ハロアルキルスルフィニル－ (C_1-C_6) －ハロアルキル、 (C_1-C_6) －ハロアルキルスルフィニル－ (C_1-C_6) －ハロアルキル、 (C_1-C_6) －ハロアルキルスルホニルオキシ、 (C_1-C_6) －ハロアルキルスルホニルオキシ、 (C_1-C_6) －アルキルチオカルボニル、 (C_1-C_6) －ハロアルキルチオカルボニル、 (C_1-C_6) －アルキルチオカルボニルオキシ、 (C_1-C_6) －ハロアルキルチオカルボニルオキシ、 (C_1-C_6) －アルキルチオ－ (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －アルキルチオ－ (C_1-C_6) －アルコキシ、 (C_1-C_6) －アルキルチオ－ (C_1-C_6) －アルキルカルボニル、 (C_1-C_6) －アルキルチオ－ (C_1-C_6) －アルキルカルボニルオキシ； (C_4-C_{14}) －アリアルスルホニル、 (C_6-C_{14}) －アリアルチオ、 (C_6-C_{14}) －アリアルスルフィニル、 (C_3-C_8) －シクロアルキルチオ、 (C_3-C_8) －アルケニルチオ、 (C_3-C_8) －シクロアルケニルチオ、 (C_3-C_6) －アルキニルチオ；

からなる群から選択され；及び、

R^{2a} 及び R^{2b} は、それぞれ、互いに独立して、

・ 水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、 $C(O)OH$ 、 $C(O)NH_2$ ；
・ (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －ハロアルキル、 (C_1-C_6) －アルキルカルボニル、 (C_1-C_6) －ハロアルキルカルボニル、 (C_1-C_6) －アルキルカルボニルオキシ、 (C_1-C_6) －ハロアルキルカルボニルオキシ、 (C_1-C_6) －アルキルカルボニル－ (C_1-C_4) －アルキル；

・ (C_1-C_6) －アルコキシ、 (C_1-C_6) －ハロアルコキシ、 (C_1-C_6) －アルコキシカルボニル、 (C_1-C_6) －ハロアルコキシカルボニル、 (C_1-C_6) －アルコキシカルボニル－ (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －ハロアルコキシカルボニル－ (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －アルコキシカルボニル－ (C_1-C_6) －ハロアルキル、 (C_1-C_6) －ハロアルコキシカルボニル－ (C_1-C_6) －ハロアルキル；

・ (C_2-C_6) －アルケニル、 (C_2-C_6) －ハロアルケニル、 (C_2-C_6) －アルケニルカルボニル、 (C_2-C_6) －ハロアルケニルカルボニル、 (C_2-C_6) －アルケニルオキシ、 (C_2-C_6) －ハロアルケニルオキシ、 (C_2-C_6) －アルケニルオキシカルボニル、 (C_2-C_6) －ハロアルケニルオキシカルボニル；

・ (C_2-C_6) －アルキニル、 (C_2-C_6) －ハロアルキニル、 (C_2-C_6) －アルキニルカルボニル、 (C_2-C_6) －ハロアルキニルカルボニル、 (C_2-C_6) －アルキニルオキシ、 (C_2-C_6) －ハロアルキニルオキシ、 (C_2-C_6) －アルキニルオキシカルボニル、 (C_2-C_6) －ハロアルキニルオキシカルボニル；

10

20

30

40

50

・ トリー (C_1-C_6) - アルキルシリル - (C_2-C_6) - アルキニル、ジ - (C_1-C_6) - アルキルシリル - (C_2-C_6) - アルキニル、モノ - (C_1-C_6) - アルキルシリル - (C_2-C_6) - アルキニル；フェニルシリル - (C_2-C_6) - アルキニル；

・ (C_6-C_{14}) - アリール、(C_6-C_{14}) - アリールオキシ、(C_6-C_{14}) - アリールカルボニル及び(C_6-C_{14}) - アリールオキシカルボニル（ここで、これらは、それぞれ、そのアリール部分において、ハロゲン、(C_1-C_6) - アルキル及び／又は(C_1-C_6) - ハロアルキルで置換されていてもよい）；

・ (C_6-C_{14}) - アリール - (C_1-C_6) - アルキル、(C_6-C_{14}) - アリール - (C_1-C_6) - アルコキシ、(C_6-C_{14}) - アリール - (C_1-C_6) - アルキル - カルボニル、(C_6-C_{14}) - アリール - (C_1-C_6) - アルキル - カルボニルオキシ、(C_6-C_{14}) - アリール - (C_1-C_6) - アルコキシカルボニル、(C_6-C_{14}) - アリール - (C_1-C_6) - アルコキシカルボニルオキシ；

・ アミノカルボニル - (C_1-C_6) - アルキル、ジ - (C_1-C_6) - アルキルアミノカルボニル - (C_1-C_6) - アルキル；

・ $N - ((C_1-C_6) - \text{ハロアルカノイル}) - \text{アミノカルボニル}$ 、モノ - (C_6-C_{14}) - アリール - アミノカルボニル、ジ - (C_6-C_{14}) - アリール - アミノカルボニル；

・ (C_1-C_6) - アルコキシ - (C_1-C_6) - アルキル、(C_1-C_6) - アルコキシ - (C_1-C_6) - アルコキシ、(C_1-C_6) - アルコキシカルボニル - (C_1-C_6) - アルコキシ；

・ (C_3-C_8) - シクロアルキル（ここで、これは、そのシクロアルキルラジカルにおいて、(C_1-C_6) - アルキル及び／又はハロゲンで置換されていてもよい）、(C_3-C_8) - シクロアルコキシ、(C_3-C_8) - シクロアルキル - (C_1-C_6) - アルキル、(C_3-C_8) - シクロアルキル - (C_1-C_6) - ハロアルキル、(C_3-C_8) - シクロアルキル - (C_1-C_6) - アルコキシ、(C_3-C_8) - シクロアルキル - (C_1-C_6) - ハロアルコキシ、(C_3-C_8) - シクロアルキルカルボニル、(C_3-C_8) - シクロアルコキシカルボニル、(C_3-C_8) - シクロアルキル - (C_1-C_6) - ハロアルキルカルボニル、(C_3-C_8) - シクロアルキル - (C_1-C_6) - ハロアルコキシカルボニル、(C_3-C_8) - シクロアルキル - (C_1-C_6) - ハロアルコキシカルボニルオキシ、(C_3-C_8) - シクロアルコキシカルボニルオキシ、(C_3-C_8) - シクロアルキル - (C_1-C_6) - アルキルカルボニルオキシ、(C_3-C_8) - シクロアルキル - (C_1-C_6) - ハロアルキルカルボニルオキシ、(C_3-C_8) - シクロアルキル - (C_1-C_6) - アルコキシカルボニルオキシ、(C_3-C_8) - シクロアルキル - (C_1-C_6) - ハロアルコキシカルボニルオキシ；

・ (C_3-C_8) - シクロアルケニル、(C_3-C_8) - シクロアルケニルオキシ、(C_3-C_8) - シクロアルケニル - (C_1-C_6) - アルキル、(C_3-C_8) - シクロアルケニル - (C_1-C_6) - ハロアルキル、(C_3-C_8) - シクロアルケニル - (C_1-C_6) - アルコキシ、(C_3-C_8) - シクロアルケニル - (C_1-C_6) - ハロアルコキシ、(C_3-C_8) - シクロアルケニルカルボニル、(C_3-C_8) - シクロアルケニルオキシカルボニル、(C_3-C_8) - シクロアルケニル - (C_1-C_6) - アルキルカルボニル、(C_3-C_8) - シクロアルケニル - (C_1-C_6) - ハロアルキルカルボニル、(C_3-C_8) - シクロアルケニル - (C_1-C_6) - アルコキシカルボニル、(C_3-C_8) - シクロアルケニル - (C_1-C_6) - ハロアルコキシカルボニル、(C_3-C_8) - シクロアルケニルカルボニルオキシ、(C_3-C_8) - シクロアルケニルオキシカルボニルオキシ、(C_3-C_8) - シクロアルケニル - (C_1-C_6) - アルキルカルボニルオキシ、(C_3-C_8) - シクロアルケニル - (C_1-C_6) - ハロアルキルカルボニルオキシ、(C_3-C_8) - シクロアルケニル - (C_1-C_6) - アルコキシ

10

20

30

40

50

カルボニルオキシ、 (C_3-C_8) -シクロアルケニル- (C_1-C_6) -ハロアルコキシカルボニルオキシ；

・ ヒドロキシ- (C_1-C_6) -アルキル、ヒドロキシ- (C_1-C_6) -アルコキシ、シアノ- (C_1-C_6) -アルコキシ、シアノ- (C_1-C_6) -アルキル；

・ (C_1-C_6) -アルキルスルホニル、 (C_1-C_6) -アルキルチオ、 (C_1-C_6) -アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) -ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_6) -ハロアルキルチオ、 (C_1-C_6) -ハロアルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) -アルキルスルホニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルキルチオ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルキルスルフィニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキルスルホニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキルチオ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキルスルフィニル- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキルスルホニル- (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキルチオ- (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキルスルフィニル- (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_1-C_6) -アルキルスルホニルオキシ、 (C_1-C_6) -ハロアルキルスルホニルオキシ、 (C_1-C_6) -アルキルチオカルボニル、 (C_1-C_6) -ハロアルキルチオカルボニル、 (C_1-C_6) -アルキルチオカルボニルオキシ、 (C_1-C_6) -ハロアルキルチオカルボニルオキシ、 (C_1-C_6) -アルキルチオ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルキルチオ- (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -アルキルチオ- (C_1-C_6) -アルキルカルボニル、 (C_1-C_6) -アルキルチオ- (C_1-C_6) -アルキルカルボニルオキシ； (C_4-C_{14}) -アリールスルホニル、 (C_6-C_{14}) -アリールチオ、 (C_6-C_{14}) -アリールスルフィニル、 (C_3-C_8) -シクロアルキルチオ、 (C_3-C_8) -アルケニルチオ、 (C_3-C_8) -シクロアルケニルチオ、 (C_3-C_6) -アルキニルチオ；

からなる群から選択され；及び、

R^3 は、

- ・ 水素、シアノ、 $C(O)OH$ 、 $C(O)NH_2$ ；
- ・ (C_1-C_6) -アルキル及び (C_1-C_6) -ハロアルキル；
- ・ (C_1-C_6) -アルコキシカルボニル；

からなる群から選択され；及び、

R^4 及び R^5 は、それぞれ、互いに独立して、水素、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、ヒドロキシ、 (C_1-C_6) -アルコキシ及び (C_1-C_6) -ハロアルコキシからなる群から選択され；又は、ラジカル R^4 とラジカル R^5 は、それらが結合している炭素原子と一緒に、3員～7員の環を形成しており；及び、

R^6 及び R^7 は、それぞれ、互いに独立して、水素、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -ハロアルコキシ、 (C_6-C_{14}) -アリール、 (C_6-C_{14}) -アリールオキシ、 (C_6-C_{14}) -アリールカルボニル及び (C_6-C_{14}) -アリールオキシカルボニルからなる群から選択され；又は、ラジカル R^6 とラジカル R^7 は、一緒に、1個以上の酸素原子及び／又は硫黄原子を含んでもよい (C_1-C_7) -アルキレン基（ここで、該 (C_1-C_7) -アルキレン基は、ハロゲンで1置換又は多置換されていてもよく、そして、当該ハロゲン置換基は、同一であっても又は異なってもよい）を形成しており；及び、

n は、連続する数0、1又は2であり；及び、

R^8 、 R^9 、 R^{10} 及び R^{11} は、それぞれ、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、 $C(O)OH$ 、 $C(O)NH_2$ 、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルキルカルボニル、 (C_1-C_6) -アルキルオキシカルボニル、 (C_1-C_6) -アルキルアミノカルボニル、 (C_1-C_6) -ジ-アルキルアミノカルボニル、 (C_1-C_6)

10

20

30

40

50

ーハロアルキル、 (C_1-C_6) ーアルコキシ、 (C_1-C_6) ーハロアルコキシ、 (C_2-C_6) ーアルケニル、 (C_2-C_6) ーアルキニル、 (C_2-C_6) ーハロアルキニル、 (C_2-C_6) ーアルキニルカルボニル、 (C_2-C_6) ーハロアルキニルカルボニル、 (C_2-C_6) ーアルキニルオキシ、 (C_2-C_6) ーハロアルキニルオキシ、 (C_2-C_6) ーアルキニルオキシカルボニル及び (C_2-C_6) ーハロアルキニルオキシカルボニル及びニトロからなる群から選択され；

Xは、結合、 CH_2 、O、S、カルボニル、NH、 $CR^{12}R^{13}$ 及び NR^{14} であるか、又は、 CH_2O 、 CH_2S （ここで、最後に挙げられている2つの基においては、その炭素原子が当該芳香族部分に結合しており、及び、ヘテロ原子O又はSは、当該アミンの部分的に水素化されている部分に結合している）であり；及び、

R^{12} 及び R^{13} は、それぞれ、互いに独立して、水素、 (C_1-C_6) ーアルキル及び (C_1-C_6) ーハロアルキルからなる群から選択され；及び、

R^{14} は、水素、 (C_1-C_6) ーアルキル、 (C_1-C_6) ーハロアルキルからなる群から選択される]

で表される化合物及びそれらの農薬的に許容される塩を提供する。

【0014】

式(I)で表される化合物は、良好な活性プロフィール及び作物植物との良好な適合性を有していることに加えて、費用効率の高い調製を特徴とする。それは、本発明による物質が、安価で容易に入手可能な前駆物質から費用効率の高い調製方法によって調製することが可能であり、従って、入手が困難な高価な中間体を使用しなくてもよいからである。

【発明を実施するための形態】

【0015】

以下において、個々の置換基のそれぞれに対して、好ましい意味、特に好ましい意味及び極めて特に好ましい意味を記載する。

【0016】

本発明の第1の実施形態は、一般式(I)〔式中、

R^1 は、好ましくは、水素、ハロゲン、シアノ、 NO_2 、 (C_1-C_6) ーアルキル、 (C_1-C_6) ーハロアルキル、 (C_1-C_6) ーアルコキシ、 (C_1-C_6) ーハロアルコキシ、 (C_1-C_6) ーアルキルチオ、 (C_1-C_6) ーアルキルスルホキシド、 (C_1-C_6) ーアルキルスルホニル、 (C_1-C_6) ーハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_6) ーアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、モノー (C_1-C_6) ーアルキルーアミノカルボニル、ジー (C_1-C_6) ーアルキルーアミノカルボニル、 (C_6-C_{14}) ーアリール、 (C_6-C_{14}) ーアリールーハロアルキル、 (C_1-C_6) ーアリールオキシ、 (C_6-C_{14}) ーハロアリールー (C_1-C_6) ーアルキル、 (C_2-C_6) ーアルキニルー (C_1-C_6) ーアルコキシ、 (C_2-C_6) ーアルキニルー (C_1-C_6) ーアルキルー (C_1-C_6) ーアルコキシ及び (C_1-C_6) ーアルキルー (C_2-C_6) ーアルキニルー (C_1-C_6) ーアルコキシからなる群から選択され；

R^1 は、特に好ましくは、シアノ(CN)、 NO_2 、 (C_1-C_3) ーアルキル、 (C_1-C_6) ーハロアルキル、 (C_1-C_6) ーアルコキシ、 (C_1-C_6) ーハロアルコキシ、 (C_1-C_6) ーアルキルチオ、 (C_1-C_6) ーアルキルスルホキシド、 (C_1-C_6) ーアルキルスルホニル、 (C_1-C_6) ーハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_6) ーアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、モノー (C_1-C_6) ーアルキルーアミノカルボニル、ジー (C_1-C_6) ーアルキルーアミノカルボニル、 (C_6-C_{14}) ーアリール、 (C_6-C_{14}) ーアリールーハロアルキル、 (C_1-C_6) ーアリールオキシ、 (C_6-C_{14}) ーハロアリールー (C_1-C_6) ーアルキル、 (C_2-C_6) ーアルキニルー (C_1-C_6) ーアルコキシ、 (C_2-C_6) ーアルキニルー (C_1-C_6) ーアルキルー (C_1-C_6) ーアルコキシ及び (C_1-C_6) ーアルキルー (C_2-C_6) ーアルキニルー (C_1-C_6) ーアルコキシからなる群から選択され；

10

20

30

40

50

R^1 は、極めて特に好ましくは、 CN 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 $CH(CH_3)_2$ 、 OCH_3 、 CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_2H 、 $CFHCH_3$ 、 CF_2CF_3 、 OCH_3 、 OCH_2CH_3 、 OCH_2CF_3 、 SCH_3 、 $SOCH_3$ 、 SO_2CH_3 、 $SO_2CH_2CH_3$ 、 SO_2CF_3 、 $COOCH_3$ 、 $COOCH_2CH_3$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHCH_3$ 、 $CON(CH_3)_2$ 、 C_6H_5- 、 $CHF-C_6H_5$ 、 OC_6H_5 、 $CH_2C_6H_4-4-Cl$ 、 $OCH_2C\equiv CH$ 、 $OCH(CH_3)C\equiv CH$ 、 $OCH_2C\equiv CCH_3$ からなる群から選択され；及び、ここで、

R^1 は、最も好ましくは、 SO_2CH_3 である〕
で表される化合物を包含する。

【0017】

本発明の第2の実施形態は、一般式 (I) 〔式中、

R^{2a} 及び R^{2b} は、それぞれ、互いに独立して、好ましくは、水素、 CN 、ヒドロキシ、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_1-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、アミノカルボニル、ヒドロキシカルボニル、 (C_1-C_6) -アルコキシカルボニル、 (C_1-C_6) -アルキルスルホニル、モノー $((C_1-C_6)$ -アルキル)-アミノカルボニル、ジ- $((C_1-C_6)$ -アルキル)-アミノカルボニル、モノー $((C_6-C_{14})$ -アリール)-アミノカルボニル、モノー $((C_2-C_6)$ -アルキレン)-アミノカルボニル、モノー $((C_6-C_{14})$ -アリール)- (C_1-C_6) -アルキル)-アミノカルボニル、 (C_1-C_6) -アルコキシ- (C_1-C_6) -アルコキシカルボニル及びジ- $((C_1-C_6)$ -アルキル)-アミノ- (C_1-C_6) -アルコキシカルボニルからなる群から選択され；

R^{2a} 及び R^{2b} は、それぞれ、互いに独立して、特に好ましくは、水素、 CN 、ヒドロキシ (OH)、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -ハロアルキル、 (C_1-C_6) -シクロアルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、アミノカルボニル、ヒドロキシカルボニル、 $COOH$ 、 (C_1-C_6) -アルコキシカルボニル、 (C_1-C_6) -アルキルスルホニル、モノー $((C_1-C_6)$ -アルキル)-アミノカルボニル、ジ- $((C_1-C_6)$ -アルキル)-アミノカルボニル、モノー $((C_6-C_{14})$ -アリール)-アミノカルボニル、モノー $((C_2-C_6)$ -アルキレン)-アミノカルボニル、モノー $((C_6-C_{14})$ -アリール)- (C_1-C_6) -アルキル)-アミノカルボニル、 (C_1-C_6) -アルコキシ- (C_1-C_6) -アルコキシカルボニル及びジ- $((C_1-C_6)$ -アルキル)-アミノ- (C_1-C_6) -アルコキシカルボニルからなる群から選択され；及び、ここで、

R^{2a} 及び R^{2b} は、それぞれ、互いに独立して、極めて特に好ましくは、水素、 CN 、ヒドロキシ (OH)、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 $CH(CH_3)_2$ 、 $C(CH_3)_3$ 、 CF_3 、 CF_2H 、 CF_2Cl 、シクロプロピル、 OCH_3 、 $CONH_2$ 、 $COOH$ 、 $COOCH_3$ 、 $COOCH_2CH_3$ 、 SO_2CH_3 、 $CONHCH_3$ 、 $CONHcyp$ 、 $CON(CH_3)_2$ 、 $CON(CH_2CH_3)_2$ 、 $CONHC_6H_5$ 、 $CONHCH_2CH=CH_2$ 、 $CONHCH_2C_6H_5$ 、 $COOCH_2CH_2OCH_3$ 、 $COOCH_2CH_2N(CH_3)_2$ からなる群から選択され；

R^{2a} 及び R^{2b} は、それぞれ、互いに独立して、最も特に好ましくは、一般式 (I) 〔式中、

R^{2a} は、水素、 CH_3 、 CH_2CH_3 及び CF_3 からなる群から選択され；及び、

R^{2b} は、水素及び CH_3 からなる群から選択される〕

で表される化合物からなる群から選択される〕

で表される化合物を包含する。

【0018】

本発明の第3の実施形態は、一般式 (I) 〔式中、

R^3 は、好ましくは、水素、 (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) -アルコキシ- (C_1-C_6) -アルキル、 (C_1-C_6) -アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 (C_6-C_{14}) -アリールからなる群から選択さ

10

20

30

40

50

れ；

R^3 は、特に好ましくは、水素、 CH_3 、 $CH_2CH_2OCH_3$ 、 $COOCH_3$ 、 $CONH_2$ 及び C_6H_5 からなる群から選択され；及び、

R^3 は、極めて特に好ましくは、水素、 CH_3 、 $CH_2CH_2OCH_3$ からなる群から選択され；及び、ここで、

R^3 は、最も好ましくは、水素である〕
で表される化合物を包含する。

【0019】

本発明の第4の実施形態は、一般式（I）〔式中、

R^4 及び R^5 は、それぞれ、互いに独立して、好ましくは、水素、シアノ、ヒドロキシ、 (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －アルキルフェニル及び (C_1-C_6) －アルコキシからなる群から選択され；

R^4 及び R^5 は、それぞれ、互いに独立して、特に好ましくは、水素、シアノ、ヒドロキシ、 (C_1-C_6) －アルキル及び (C_1-C_6) －アルコキシからなる群から選択され；

R^4 及び R^5 は、それぞれ、互いに独立して、特に好ましくは、水素、シアノ、ヒドロキシ、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 $CH_2C_6H_5$ 及び OCH_3 からなる群から選択され；及び、ここで、

R^4 及び R^5 は、それぞれ、互いに独立して、最も好ましくは、メチル又は水素である〕
で表される化合物を包含する。

【0020】

従って、この第4の実施形態においては、ラジカル R^4 とラジカル R^5 のうちの少なくとも一方が水素であれば、特に好ましい。さらにまた、好ましくは、ラジカル R^4 とラジカル R^5 のうちの少なくとも一方が水素であり且つ残りのラジカル R^4 及びラジカル R^5 は水素ではない（特に、 (C_1-C_6) －アルキル、好ましくは、メチル（ CH_3 ）である）。

【0021】

本発明の第5の実施形態は、一般式（I）〔式中、

R^4 と R^5 は、好ましくは、 (C_1-C_7) －アルキレン基であり、そして、それらが結合している炭素原子と一緒に、3員～7員の環を形成しており；

R^4 と R^5 は、特に好ましくは、 (C_1-C_3) －アルキレン基であり、そして、それらが結合している炭素原子と一緒に、3員又は4員の環を形成しており；及び、ここで、

R^4 と R^5 は、極めて特に好ましくは、アルキレン基（ $-CH_2-CH_2-$ ）であり、そして、それらが結合している炭素原子と一緒に、3員環を形成している〕

で表される化合物を包含する。

【0022】

本発明の第6の実施形態は、一般式（I）〔式中、

R^6 及び R^7 は、互いに独立して、好ましくは、水素、 (C_1-C_6) －アルキル及び (C_6-C_{14}) －アリールからなる群から選択され；

R^6 及び R^7 は、互いに独立して、特に好ましくは、水素、メチル及びフェニルからなる群から選択され；及び、ここで、

R^6 及び R^7 は、極めて特に好ましくは、水素である〕
で表される化合物を包含する。

【0023】

本発明の第7の実施形態は、一般式（I）〔式中、

R^8 は、好ましくは、水素、ハロゲン、 (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －アルコキシ及びジ－ (C_1-C_6) －アルキルアミノからなる群から選択され；

R^8 は、特に好ましくは、水素、ハロゲン、 (C_1-C_6) －アルキル、 (C_1-C_6) －アルコキシ及びジ－ (C_1-C_6) －アルキルアミノからなる群から選択され；及び

、
 R^8 は、極めて特に好ましくは、水素、フッ素、塩素、 CH_3 、 OCH_3 及び $N(CH_3)_2$ からなる群から選択され；及び、ここで、

R^8 は、最も好ましくは、水素である]
 で表される化合物を包含する。

【0024】

本発明の第8の実施形態は、一般式 (I) [式中、
 R^9 は、好ましくは、水素、ハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシからなる群から選択され；

R^9 は、特に好ましくは、水素、塩素、フッ素、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル及び $(C_1 - C_6)$ - アルコキシからなる群から選択され；及び、

R^9 は、極めて特に好ましくは、水素、フッ素、塩素、メチル及びメトキシからなる群から選択される；及び、ここで

R^9 は、最も好ましくは、水素である]
 で表される化合物を包含する。

【0025】

本発明の第9の実施形態は、一般式 (I) [式中、
 R^{10} は、好ましくは、水素、ハロゲン、シアノ、アミノカルボニル、ヒドロキシカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_2 - C_6)$ - アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル及び $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(C_2 - C_6)$ - アルキニルからなる群から選択され；

R^{10} は、特に好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、 $CONH_2$ 、 $COOH$ 、メチル (CH_3)、エチル (CH_2CH_3)、メトキシ (OCH_3)、 $CH=CH_2$ 、 $C\equiv CH$ 及び $C\equiv CCH_3$ からなる群から選択され；及び、ここで、

R^{10} は、極めて特に好ましくは、水素又はメチルである]
 で表される化合物を包含する。

【0026】

本発明の第10の実施形態は、一般式 (I) [式中、
 R^{11} は、好ましくは、水素及び $(C_1 - C_6)$ - アルキルからなる群から選択され；
 R^{11} は、特に好ましくは、水素及びメチルからなる群から選択され；及び、
 R^{11} は、極めて特に好ましくは、水素である]
 で表される化合物を包含する。

【0027】

本発明の第11の実施形態は、一般式 (I) [式中、
 X は、好ましくは、 O 、 S 、カルボニル、 CH_2 、 NH 、 $CH - (C_1 - C_6)$ - アルキル、ジ - $(C_1 - C_6)$ - アルキル - アルキレン、 $O - (C_1 - C_7)$ - アルキレン、 $S - (C_1 - C_7)$ - アルキレン、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルアミノからなる群から選択されるか；又は、ここで、 X は、化学結合であり；

X は、特に好ましくは、 O 、 S 、カルボニル、 CH_2 、 NH 、 $CHCH_3$ 、 NCH_3 、 $C(CH_3)_2$ 、 OCH_2 、 SCH_2 からなる群から選択されるか；又は、ここで、 X は、化学結合であり；

X は、極めて特に好ましくは、 O 及び S からなる群から選択されるか；又は、ここで、 X は、化学結合である]
 で表される化合物を包含する。

【0028】

本発明に関連して、置換基 $R^1 \sim R^{11}$ 及び X の特定の好ましい意味、特に好ましい意味及び極めて特に好ましい意味は、必用に応じて、互いに組み合わせることが可能である。このことは、本発明が一般式 (I) [式中、例えば、置換基 R^1 は好まし意味を有し且つ置換基 $R^2 \sim R^{14}$ は一般的な意味を有する、又は、置換基 R^2 は好ましい意味を有し且つ置換基 R^3 は特に好まし意味若しくは極めて特に好ましい意味を有し且つ残りの置換

10

20

30

40

50

基は一般的な意味を有する〕で表される化合物を包含していることを意味する。

【0029】

置換基 $R^1 \sim R^{11}$ 及び X に関して上記で与えられている定義のこれら組合せのうちの 3 つについて、さらなる実施形態として、以下に代表的な方法で開示及び例証する：

— 置換基 $R^1 \sim R^{11}$ 及び X に関して特に好ましいものとして上記で言及されている定義の組合せ（第 12 の実施形態）；

— 置換基 $R^1 \sim R^{11}$ 及び X に関して極めて特に好ましいものとして上記で言及されている定義の組合せ（第 13 の実施形態）；及び、

— 置換基 R^1 に関して極めて特に好ましいものとして上記で言及されている定義と置換基 $R^2 \sim R^{11}$ 及び X に関して極めて特に好ましいものとして上記で言及されている定義の組合せ（第 14 の実施形態）。

10

【0030】

本発明の第 12 の実施形態は、一般式 (I) 〔式中、

R^1 は、シアノ (CN)、 NO_2 、 $(C_1 - C_3)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルホキシド、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - カルボニル、アミノ - カルボニル、モノ - $((C_1 - C_6)$ - アルキル) - アミノ - カルボニル、ジ - $((C_1 - C_6)$ - アルキル) - アミノ - カルボニル、 $(C_6 - C_{14})$ - アリール、 $(C_6 - C_{14})$ - アリール - ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アリールオキシ、 $(C_6 - C_{14})$ - ハロアリール - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル - $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、 $(C_2 - C_6)$ - アルキニル - $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ及び $(C_1 - C_6)$ - アルキル - $(C_2 - C_6)$ - アルキニル - $(C_1 - C_6)$ - アルコキシからなる群から選択され；

20

R^{2a} 及び R^{2b} は、それぞれ、互いに独立して、水素、 CN 、ヒドロキシ (OH)、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - シクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ、アミノカルボニル、ヒドロキシカルボニル $COOH$ 、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルキルスルホニル、モノ - $((C_1 - C_6)$ - アルキル) - アミノ - カルボニル、ジ - $((C_1 - C_6)$ - アルキル) - アミノ - カルボニル、モノ - $((C_6 - C_{14})$ - アリール) - アミノ - カルボニル、モノ - $((C_2 - C_6)$ - アルキレン) - アミノ - カルボニル、モノ - $((C_6 - C_{14})$ - アリール - $(C_1 - C_6)$ - アルキル) - アミノ - カルボニル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ - カルボニル及びジ - $((C_1 - C_6)$ - アルキル) - アミノ - $(C_1 - C_6)$ - アルコキシカルボニルからなる群から選択され；

30

R^3 は、水素、 CH_3 、 $CH_2CH_2OCH_3$ 、 $COOCH_3$ 、 $CONH_2$ 及び C_6H_5 からなる群から選択され；

R^4 及び R^5 は、それぞれ、互いに独立して、水素、シアノ、ヒドロキシ、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル及び $(C_1 - C_6)$ - アルコキシからなる群から選択され；又は、代替的に、

R^4 と R^5 は、 $(C_1 - C_3)$ - アルキレン基であり、そして、それらが結合している炭素原子と一緒に、3 員又は 4 員の環を形成しており；

40

R^6 及び R^7 は、互いに独立して、水素、メチル及びフェニルからなる群から選択され；

R^8 は、水素、ハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ及びジ - $(C_1 - C_6)$ - アルキルアミノからなる群から選択され；

R^9 は、水素、塩素、フッ素、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル及び $(C_1 - C_6)$ - アルコキシからなる群から選択され；

R^{10} は、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、 $CONH_2$ 、 $COOH$ 、メチル (CH_3)、エチル (CH_2CH_3)、メトキシ (OCH_3)、 $CH=CH_2$ 、 $C \equiv CH$ 及び $C \equiv CCH_3$ からなる群から選択され；

50

R^{11} は、水素及びメチルからなる群から選択され；及び、ここで、

Xは、O、S、カルボニル、 CH_2 、NH、 $CHCH_3$ 、 NCH_3 、 $C(CH_3)_2$ 、 OCH_2 、 SCH_2 からなる群から選択されるか；又は、ここで、Xは、化学結合である]

で表される化合物を包含する。

【0031】

本発明の第13の実施形態は、一般式(I)〔式中、

R^1 は、CN、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 $CH(CH_3)_2$ 、 OCH_3 、 CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_2H 、 $CFHCH_3$ 、 CF_2CF_3 、 OCH_3 、 OCH_2CH_3 、 OCH_2CF_3 、 SCH_3 、 $SOCH_3$ 、 SO_2CH_3 、 $SO_2CH_2CH_3$ 、 SO_2CF_3 、 $COOCH_3$ 、 $COOCH_2CH_3$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHCH_3$ 、 $CON(CH_3)_2$ 、 C_6H_5 、 $CHF-C_6H_5$ 、 OC_6H_5 、 $CH_2C_6H_4-4-Cl$ 、 $OCH_2C\equiv CH$ 、 $OCH(CH_3)C\equiv CH$ 、 $OCH_2C\equiv CCH_3$ からなる群から選択され；

10

R^{2a} 及び R^{2b} は、それぞれ、互いに独立して、水素、CN、ヒドロキシ(OH)、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 $CH(CH_3)_2$ 、 $C(CH_3)_3$ 、 CF_3 、 CF_2H 、 CF_2Cl 、シクロプロピル、 OCH_3 、 $CONH_2$ 、 $COOH$ 、 $COOCH_3$ 、 $COOCH_2CH_3$ 、 SO_2CH_3 、 $CONHCH_3$ 、 $CONHcyp$ 、 $CON(CH_3)_2$ 、 $CON(CH_2CH_3)_2$ 、 $CONHC_6H_5$ 、 $CONHCH_2CH=CH_2$ 、 $CONHCH_2C_6H_5$ 、 $COOCH_2CH_2OCH_3$ 、 $COOCH_2CH_2N(CH_3)_2$ からなる群から選択され；

20

R^3 は、水素、 CH_3 、 $CH_2CH_2OCH_3$ からなる群から選択され；及び、ここで、

R^4 及び R^5 は、それぞれ、互いに独立して、水素、シアノ、ヒドロキシ、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 $CH_2C_6H_5$ 及び OCH_3 からなる群から選択され；又は、代替的に、

R^4 と R^5 は、アルキレン基($-CH_2-CH_2-$)であり、そして、それらが結合している炭素原子と一緒に、3員環を形成しており；

R^6 及び R^7 は、互いに独立して、水素、メチル及びフェニルからなる群から選択され；

R^8 は、水素、フッ素、塩素、 CH_3 、 OCH_3 及び $N(CH_3)_2$ からなる群から選択され；

30

R^9 は、水素、フッ素、塩素、メチル及びメトキシからなる群から選択され；

R^{10} は、水素又はメチルであり；

R^{11} は、水素であり；及び、ここで、

Xは、O及びSからなる群から選択されるか；又は、ここで、Xは、化学結合である〕で表される化合物を包含する。

【0032】

本発明の第14の実施形態は、一般式(I)〔式中、

R^1 は、CN、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 $CH(CH_3)_2$ 、 OCH_3 、 CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_2H 、 $CFHCH_3$ 、 CF_2CF_3 、 OCH_3 、 OCH_2CH_3 、 OCH_2CF_3 、 SCH_3 、 $SOCH_3$ 、 SO_2CH_3 、 $SO_2CH_2CH_3$ 、 SO_2CF_3 、 $COOCH_3$ 、 $COOCH_2CH_3$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHCH_3$ 、 $CON(CH_3)_2$ 、 C_6H_5 、 $CHF-C_6H_5$ 、 OC_6H_5 、 $CH_2C_6H_4-4-Cl$ 、 $OCH_2C\equiv CH$ 、 $OCH(CH_3)C\equiv CH$ 、 $OCH_2C\equiv CCH_3$ からなる群から選択され；

40

R^3 は、水素、 CH_3 、 $CH_2CH_2OCH_3$ 、 $COOCH_3$ 、 $CONH_2$ 及び C_6H_5 からなる群から選択され；

R^4 及び R^5 は、それぞれ、互いに独立して、水素、シアノ、ヒドロキシ、 (C_1-C_6) -アルキル及び (C_1-C_6) -アルコキシ以下のものからなる群から選択され；又は、代替的に、

50

R^4 と R^5 は、 $(C_1 - C_3)$ - アルキレン基であり、そして、それらが結合している炭素原子と一緒に、3員又は4員の環を形成しており；

R^6 及び R^7 は、互いに独立して、水素、メチル及びフェニルからなる群から選択され；

R^8 は、水素、ハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシ及びジ- $(C_1 - C_6)$ - アルキルアミノからなる群から選択され；

R^9 は、水素、塩素、フッ素、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル及び $(C_1 - C_6)$ - アルコキシからなる群から選択され；

R^{10} は、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、 $CONH_2$ 、 $COOH$ 、メチル (CH_3)、エチル (CH_2CH_3)、メトキシ (OCH_3)、 $CH=CH_2$ 、 $C\equiv CH$ 及び $C\equiv CCH_3$ からなる群から選択され；

R^{11} は、水素及びメチルからなる群から選択され；及び、ここで、

X は、O、S、カルボニル、 CH_2 、NH、 $CHCH_3$ 、 NCH_3 、 $C(CH_3)_2$ 、 OCH_2 、 SCH_2 からなる群から選択されるか；又は、ここで、X は、化学結合である]

で表される化合物を包含する。

【0033】

本発明に関連して、一般式 (I) で表される化合物は、(a) プロトン化、(b) アルキル化又は (c) 酸化によって窒素原子において4級化されている化合物も包含する。これに関連して、特に、対応するN-オキシドについて言及することができる。

【0034】

式 (I) で表される化合物は、塩を形成し得る。塩は、酸性水素原子を有している式 (I) で表される化合物 (例えば、 R^1 が、 $COOH$ 基又はスルホンアミド基 $-NH-SO_2-$ を含んでいる場合) に塩基を作用させることによって、形成させることができる。適切な塩基の例は、有機アミン類、例えば、トリアルキルアミン類、モルホリン、ピペリジン又はピリジン、並びに、アンモニウム、アルカリ金属若しくはアルカリ土類金属の水酸化物、炭酸塩及び炭酸水素塩、特に、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム及び炭酸水素カリウムである。これらの塩は、当該酸性水素が農業上適切なカチオンで置き換えられている化合物、例えば、金属塩、特に、アルカリ金属塩若しくはアルカリ土類金属塩、特に、ナトリウム塩及びカリウム塩、又は、アンモニウム塩、有機アミンとの塩、又は、第4球アンモニウム塩、例えば、式 $[NR^1R^2R^3R^4]^+ [式中、R\sim R^1, R^2, R^3, R^4]$ は、それぞれ、互いに独立して、有機ラジカル、特に、アルキル、アリール、アラキル又はアルキルアリールである] で表されるカチオンとの塩である。同様に有用なのは、アルキルスルホニウム塩及びアルキルスルホキソニウム塩、例えば、 $(C_1 - C_4)$ - トリアルキルスルホニウム塩及び $(C_1 - C_4)$ - トリアルキルスルホキソニウム塩である。

【0035】

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

【0036】

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

【0037】

式 (I) で表される化合物及びそれらの塩は、以下では、本発明による「化合物 (I)」

」とも称されるか、又は、本発明に従って使用される。

【0038】

一般式(I)及び本発明によるその他の全ての式において、ラジカルアルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルキルアミノ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ並びに対応する不飽和の及び／又は置換されているラジカルは、いずれの場合にも、炭素骨格内において直鎖又は分枝鎖であることができる。具体的に示されていない限り、これらのラジカルに関して好ましいのは、低級炭素骨格、例えば、1～6個の炭素原子（特に、1～4個の炭素原子）を有する炭素骨格、又は、不飽和基の場合には、2～6個の炭素原子（特に、2～4個の炭素原子）を有する炭素骨格である。単独のアルキルラジカル及び複合的な定義（例えば、アルコキシ、ハロアルキルなど）におけるアルキルラジカルは、例えば、メチル、エチル、n-プロピル又はイソプロピル、n-ブチル、イソブチル、tert-ブチル又は2-ブチル、ペンチル類、ヘキシル類、例えば、n-ヘキシル、イソヘキシル及び1, 3-ジメチルブチル、ヘプチル類、例えば、n-ヘプチル、1-メチルヘキシル及び1, 4-ジメチルペンチルであり；アルケニルラジカル及びアルキニルラジカルは、上記アルキルラジカルに対応する可能な不飽和ラジカルの定義を有している；その際、それぞれ、少なくとも1の二重結合又は三重結合が存在しており、好ましくは、1つの二重結合又1つの三重結合が存在している。アルケニルは、例えば、ビニル、アリル、1-メチルプロパー2-エン-1-イル、2-メチルプロパー2-エン-1-イル、ブター2-エン-1-イル、ブター3-エン-1-イル、1-メチルブター3-エン-1-イル及び1-メチルブター2-エン-1-イルであり；アルキニルは、例えば、エチニル、プロパルギル、ブター2-イン-1-イル、ブター3-イン-1-イル及び1-メチルブター3-イン-1-イルである。

10

20

【0039】

シクロアルキル基は、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル及びシクロオクチルである。該シクロアルキル基は、二環式形態又は三環式形態で存在することができる。

【0040】

ハロアルキル基及びハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、ハロアルケニル、ハロアルキニルなどにおけるハロアルキルラジカルについて述べられている場合、これらのラジカル（例えば、1～6個の炭素原子又は2～6個の炭素原子、特に、1～4個の炭素原子、又は、好ましくは、2～4個の炭素原子を有するラジカル）並びに対応する不飽和の及び／又は置換されているラジカルの低級炭素骨格は、いずれの場合にも、炭素骨格内において直鎖又は分枝鎖である。その例は、ジフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、トリフルオロアリル、1-クロロプロパー1-イル-3-イルである。

30

【0041】

これらのラジカルの中のアルキレン基並びにいずれの場合にも直鎖又は分枝鎖であり得る炭素骨格内の対応する不飽和の及び／又は置換されているラジカルの中のアルキレン基は、低級炭素骨格、例えば、1～10個の炭素原子、特に、1～6個の炭素原子、又は、好ましくは、2～4個の炭素原子を有する炭素骨格である。その例は、メチレン、エチレン、n-プロピレン、イソプロピレン、n-ブチレン、s-ブチレン、イソブチレ及びtert-ブチレンである。

40

【0042】

これらのラジカルの中のヒドロキシアルキル基並びにいずれの場合にも直鎖又は分枝鎖であり得る炭素骨格内の対応する不飽和の及び／又は置換されているラジカルの中のヒドロキシアルキル基は、低級炭素骨格、例えば、1～6個の炭素原子、特に、1～4個の炭素原子を有する炭素骨格である。それらの例は、1, 2-ジヒドロキシエチル及び3-ヒドロキシプロピルである。

【0043】

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素である。ハロアルキル、ハロアルケニル及びハロアルキニルは、ハロゲンで（好ましくは、フッ素、塩素又は臭素で、特に、フッ素

50

及び／又は塩素で）部分的に又は完全に置換されているアルキル、アルケニル及びアルキニルであり、例えば、モノハロアルキル、ペルハロアルキル、 CF_3 、 CF_2Cl 、 CHF_2 、 CH_2F 、 CF_3CF_2 、 CH_2FCHCl 、 CCl_3 、 CHCl_2 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ である；ハロアルコキシは、例えば、 OCF_3 、 OCHF_2 、 OCH_2F 、 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{O}$ 、 OCH_2CF_3 及び $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ である；同様のことは、対応して、ハロアルケニル及び別のハロゲン置換ラジカルにも当てはまる。

【0044】

アリールは、単環式、二環式又は多環式の芳香族系、例えば、フェニル又はナフチルであり、好ましくは、フェニルである。

【0045】

主に、高い除草活性、良好な選択性及び／又は良好な製造可能性を有しているという理由で、本発明による一般式（I）〔式中、個々のラジカルは、既に特定されているか又は以下で特定されている好ましい意味のうちの1つを有する〕で表される化合物若しくはその農芸化学的塩若しくは第4級N誘導体、又は、特に、本発明による一般式（I）〔式中、既に特定されているか又は以下で特定されている好ましい意味のうちの1つ以上が組み合わされて存在している〕で表される化合物若しくはその農芸化学的塩若しくは第4級N誘導体は、特に興味深い。

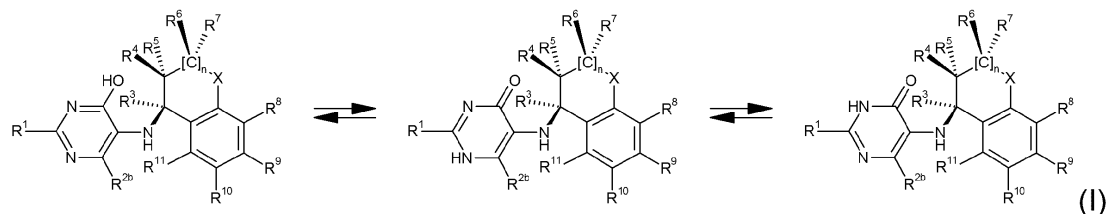
【0046】

上記で記載されているラジカルの一般的な定義又は好ましい定義は、一般式（I）で表される最終生成物並びに対応していずれの場合にも調製に必要とされる出発物資及び中間体の両方に適用される。ラジカルに関するこれらの定義は、必用に応じて互いに交換することが可能である。即ち、所与の好ましい範囲の間の組合せを包含する。

【0047】

互変異性体が可能な場合、記載されている形態は、可能な全ての互変異性体構造を包含している。以下に示されているように、例えば、 R^{2a} = ヒドロキシである場合、可能なケト互変異性体も包含される。

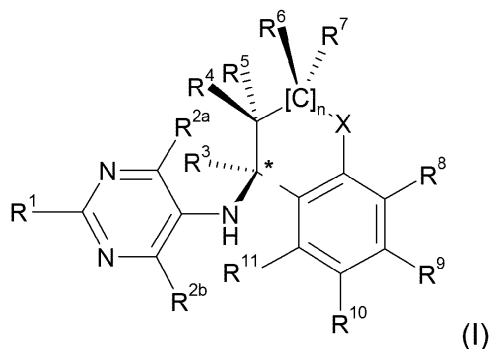
【化2】



【0048】

一般式（I）で表される本発明の化合物は、以下に示されている構造の中で印（*）で示されているキラル炭素原子を有している。

【化3】



【0049】

Cahn、Ingold及びPrelogの規則（CIP規則）によれば、この炭素原子は、（R）立体配置又は（S）立体配置のいずれかを有することができる。

10

20

30

40

50

【0050】

本発明は、(S) 立体配置を有する一般式 (I) で表される化合物と (R) 立体配置を有する一般式 (I) で表される化合物の両方を包含する。即ち、本発明は、一般式 (I) [式中、当該炭素原子は、

(1) (R) 立体配置；又は、

(2) (S) 立体配置

を有している]

で表される化合物を包含する。

【0051】

さらに、本発明の範囲には、以下のものも包含される：

(3) (R) 立体配置を有する一般式 (I) で表される化合物 (一般式 (I - (R) で表される化合物) と (S) 立体配置を有する一般式 (I) で表される化合物 (一般式 (I - (S) で表される化合物) の任意の混合物：

ここで、(R) 立体配置を有する一般式 (I) で表される化合物と (S) 立体配置を有する一般式 (I) で表される化合物のラセミ混合物も、本発明に包含される。

【0052】

しかしながら、本発明に関連して、好ましくは、特に、60～100% (好ましくは、80～100%、特に、90～100%、極めて特に好ましくは、95～100%) の選択性で (R) 立体配置を有する一般式 (I) で表される化合物を使用する [ここで、特定の (R) 化合物は、当該 (R) 化合物の総含有量に基づいて、いずれの場合にも、50% ee を超えるエナンチオ選択性 (好ましくは、60～100% ee のエナンチオ選択性、特に、80～100% ee のエナンチオ選択性、極めて特に、90～100% ee のエナンチオ選択性、最も好ましくは、95～100% ee のエナンチオ選択性) で存在している]。

【0053】

従って、本発明は、特に、一般式 (I*) [式中、(*) が付けられている炭素原子における立体化学的配置が、60～100% (R) (好ましくは、80～100% (R)、特に、90～100% (R)、極めて特に、95～100% (R)) の立体化学的純度で存在している] で表される化合物に関する。

【0054】

Cahn、Ingold及びPrelogの規則を考慮すれば、(*) が付けられている炭素原子において、当該置換基の優先順位に起因して、(*) が付けられている炭素原子では (S) 立体配置が好ましい状況もあり得る。これは、例えば、ラジカル R⁴ 及び／又は R⁵ が C₁ - C₆ - アルコキシラジカルに対応しているような場合である。

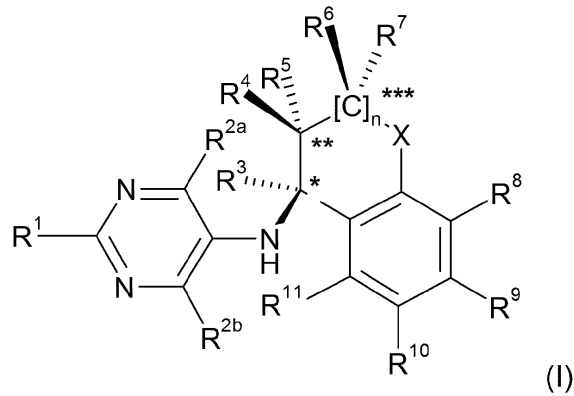
【0055】

従って、本発明に関連して、好ましいのは、特に、その空間的な配置が一般式 (I) [式中、R⁴ 及び R⁵ は、60～100% (好ましくは、80～100%、特に、90～100%、極めて特に好ましくは、95～100%) の選択性で (R) 立体配置を有している水素である] で表される化合物の空間的な配置に相当する一般式 (I) で表される化合物であり、その際、個々の (R) - 類似化合物が、当該 (R) - 類似化合物の総含有量に基づいて、いずれの場合にも、50% ee を超える (好ましくは、60～100% ee の、特に、80～100% ee の、極めて特に好ましくは、90～100% ee の、最も好ましくは、95～100% ee の) エナンチオ選択性で存在している。従って、本発明は、特に、式中の (*) が付けられている炭素原子における立体化学的配置が 60～100% (R 又は R-類似体) [好ましくは、80～100% (R 又は R-類似体)、特に、90～100% (R 又は R-類似体)、極めて特に、95～100% (R 又は R-類似体)] の立体化学的純度で存在している一般式 (I) で表される化合物に関する。

【0056】

特に、一般式 (I) で表される本発明の化合物は、(**) 及び (***) が付けられている炭素原子において、さらなるキラル中心を有し得る：

【化 4】



10

【0057】

本発明に関連して、(*)、(**)及び(***)が付けられている炭素原子において、任意の立体化学的配置が可能である：

【表 1】

炭素原子 (*) の立体配置	炭素原子 (**) の立体配置	炭素原子 (***) の立体配置
R	R	R
R	R	S
R	S	R
S	R	R
R	S	S
S	R	S
S	S	R
S	S	S

20

【0058】

さらに、選択された個々のラジカルに応じて、本発明による一般式 (I) で表される化合物の中には、さらなる立体成分 (stereoelement) が存在し得る。

【0059】

例えば、1 以上のアルケニル基が存在している場合、ジアステレオマー (Z 異性体及び E 異性体) が生じ得る。

【0060】

例えば、1 以上の不斉炭素原子が存在している場合、エナンチオマー及びジアステレオマーが生じ得る。

【0061】

対応する立体異性体は、当該調製において得られた混合物から、慣習的な分離方法によって、例えば、クロマトグラフィー分離方法によって、得ることができる。光学的に活性な出発物質及び／又は補助剤を用いる立体選択的反応を使用して、立体異性体を選択的に調製することも、同様に可能である。従って、本発明は、一般式 (I) には包含されるがその具体的な立体的形態では示されていない全ての立体異性体及びそれらの混合物にも関する。

40

【0062】

一般式 (I) のさまざまな置換基の可能な組合せに関して、化学的化合物の構造についての一般的な原則に従わなければならない。即ち、化学的に不可能であるものとして当業者には知られている化合物は、式 (I) には包含されない。

【0063】

50

一般式（I）で表される化合物の例が、以下に、表形式で示されている。

【0064】

下記表において：

- ・ 「StNR³」は、NHとR³が結合している炭素原子における立体化学的配置であり、「StR⁴R⁵」及び「StR⁶R⁷」は、同様に、当該個々の置換基が結合している炭素原子である；
- ・ 該置換基の結合は、いずれの場合にも、左側にある；
- ・ Xに対して2つの結合部位が与えられている場合、左側の結合は当該芳香族環に結合しており、そして、右側の結合は当該二環式アミンの水素化されている部分に結合している；
- ・ 「cyp rop」は、シクロプロピルを意味している；
- ・ ハイフン「-」は、直接結合を示している；及び、
- ・ n = 0である場合、下記表は、R⁶とR⁷に関する対応する領域に記載事項を有していない。

【表2】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.	CF ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
2.	SOCH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
3.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
4.	NO ₂	H	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
5.	CN	H	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
6.	CONH ₂	H	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
7.	COOCH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
8.	CONHCH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
9.	CONHcyp rop	H	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
10.	CF ₂ CF ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
11.	CF ₂ CF ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
12.	CF ₂ CF ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	H	H	O
13.	CF ₂ CF ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	H	H	S
14.	CF ₂ CF ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	H	H	-
15.	CF ₂ CF ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	H	H	-
16.	CF ₂ CF ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
17.	CF ₂ CF ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2		F	H	H	H	-

【0065】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
18.	CF ₂ CF ₃	OCH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
19.	CF ₂ CF ₃	OCH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
20.	CF ₂ CF ₃	OCH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	2		H	H	CH ₃	H	-
21.	CF ₂ CF ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
22.	CF ₂ CF ₃	OCH ₃	H	H	R	H	H		H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
23.	CF ₂ CF ₃	OCH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
24.	CF ₂ CF ₃	OCH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	2		H	H	F	H	-
25.	CF ₃	OCH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
26.	SOCH ₃	H	H	CH ₃	rac	H	H		H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
27.	SO ₂ CH ₃	H	H	CH ₃	rac	H	H		H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
28.	SO ₂ CH ₃	H	H	CH ₃	rac	H	H		H	H	1		H	H	H	H	-
29.	SO ₂ CH ₃	H	H	CH ₃	rac	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
30.	SO ₂ CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	rac	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
31.	SO ₂ CH ₃	H	H	Ph	rac	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
32.	SO ₂ CH ₃	H	H	COOCH ₃	rac	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
33.	SO ₂ CH ₃	H	H	CONH ₂	rac	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
34.	SO ₂ CH ₃	H	H	CONH ₂	rac	H	H		H	H	1		H	H	H	H	-

10

20

【 0 0 6 6 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
35.	CF ₃	H	H	CONH ₂	rac	H	H		H	H	1		H	H	H	H	-
36.	CN	H	H	CONH ₂	rac	H	H		H	H	1		H	H	H	H	-
37.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H				0		CH ₃	CH ₃	H	H	O
38.	CN	H	H	H	rac	H	H				0		CH ₃	CH ₃	H	H	O
39.	CF ₃	H	H	H	rac	H	H				0		CH ₃	CH ₃	H	H	O
40.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	Cl	H	H	-
41.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	F	H	H	-
42.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	F	H	-
43.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	Cl	H	-
44.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	OCH ₃	OCH ₃	H	-
45.	CN	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	Cl	H	H	-
46.	CF ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	Cl	H	H	-
47.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	CH ₃	H	S
48.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	F	H	S
49.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		CH ₃	H	CH ₃	H	S
50.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		Cl	H	Cl	H	S
51.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		CH ₃	H	OCH ₃	H	S

30

40

【 0 0 6 7 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
52.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		OCH ₃	H	H	H	S
53.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		OCH ₂ C H ₃	H	H	H	S
54.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		N(CH ₃) ₂	H	H	H	S
55.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	Br	H	S
56.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	C≡CH	H	S
57.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	C≡CCH ₃	H	S
58.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	CN	H	S
59.	CF ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	CH ₃	H	S
60.	CN	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	CH ₃	H	S
61.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	H	H	S
62.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		CH ₃	H	CH ₃	H	O
63.	CF ₂ CF ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
64.	CN	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	CH ₂ CH ₃	H	O
65.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	CH ₂ CH ₃	H	O
66.	SO ₂ CH ₃	CN	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	CH ₂ CH ₃	H	O
67.	SO ₂ CH ₃	CONH ₂	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	CH ₂ CH ₃	H	O
68.	SO ₂ CH ₃	COOH	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	CH ₂ CH ₃	H	O

10

20

【 0 0 6 8 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
69.	SO ₂ CH ₃	COOCH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	CH ₂ CH ₃	H	O
70.	CF ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	CH ₂ CH ₃	H	O
71.	SOCH ₃	OCH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
72.	SO ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
73.	SOCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H	R	H	H		H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
74.	SOCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
75.	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
76.	CN	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
77.	COOCH ₂ CH ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
78.	COOCH ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
79.	CONH ₂	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
80.	CON(CH ₃) ₂	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
81.	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
82.	COOCH ₂ CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
83.	CN	H	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
84.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	OCH ₃	H	H	O
85.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		OCH ₃	OCH ₃	H	H	O

30

40

【 0 0 6 9 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
86.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	OCH ₃	OCH ₃	H	O
87.	SO ₂ CH ₃	CONH ₂	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
88.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	CN	H	rac	H	H	1		H	H	H	H	-
89.	SO ₂ CH ₃	CN	H	H	rac	H	H				0		H	H	H	H	O
90.	SO ₂ CH ₃	CONH ₂	H	H	rac	H	H		H	H	1		F	H	H	H	-
91.	CF ₃	CONH ₂	H	H	rac	H	H				0		H	H	H	H	O
92.	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	H	H	O
93.	SO ₂ CH ₃	CONH ₂	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
94.	SCH ₃	OH	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
95.	SCH ₃	OH	CF ₂ H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
96.	SCH ₃	H	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
97.	SO ₂ CH ₃	OH	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
98.	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
99.	CN	CN	H	H	R	H	H		H	H	1		H	H	H	H	-
100	CN	CN	CF ₃	H	R	H	H		H	H	1		H	H	H	H	-
101	CN	CN	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-

10

20

【 0 0 7 0 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
102	CN	CN	CF ₃	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
103	CN	CN	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
104	CN	CN	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
105	SO ₂ CH ₃	CONH ₂	H	H	R	H	H		H	H	1		H	H	H	H	-
106	SO ₂ CH ₃	CN	H	H	R	H	H		H	H	1		H	H	H	H	-
107	SO ₂ CH ₃	COOCH ₃	H	H	R	H	H		H	H	1		H	H	H	H	-
108	SO ₂ CH ₃	CN	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
109	SO ₂ CH ₃	CN	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
110	SO ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	F	H	-

30

40

【 0 0 7 1 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
111	CF ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		CH ₃	H	H	H	-
112	CF ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		Cl	H	H	H	-
113	CF ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	F	H	-
114	CF ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	CH ₂ CH ₃	H	-
115	CF ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	1		H	H	H	H	-
116	CF ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
117	CF ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
118	C ₆ H ₅	COOH	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
119	C ₆ H ₅	CONH ₂	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-

10

20

【 0 0 7 2 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
120	C ₆ H ₅	H	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
121	C ₆ H ₅	OH	CH ₃	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
122	C ₆ H ₅	OH	cyprop	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
123	C ₆ H ₅	OH	CH ₃	H	R	H	H		H	H	1		H	H	H	H	-
124	C ₆ H ₅	OH	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
125	C ₆ H ₅	OH	cyprop	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
126	C ₆ H ₅	OH	cyprop	H	R	H	H		H	H	1		H	H	H	H	-
127	CH ₃	COOH	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
128	CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-

30

40

【 0 0 7 3 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
129	SCH ₃	COOH	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
130	SCH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
131	SO ₂ CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	1		H	H	H	H	-
132	SO ₂ CH ₃	COOH	H	H	R	H	H		H	H	1		H	H	H	H	-
133	SO ₂ CH ₃	COOCH ₂ CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	1		H	H	H	H	-
134	SO ₂ CH ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
135	SO ₂ CH ₃	CONHCH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
136	SO ₂ CH ₃	CONHCH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
137	SO ₂ CH ₃	CONHCH ₂ CH =CH ₂	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-

10

20

【 0 0 7 4 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
138	SO ₂ CH ₃	CONHcyprop	H	CH ₃	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
139	SO ₂ CH ₃	CONHcyprop	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
140	SO ₂ CH ₃	CONHC ₆ H ₅	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
141	SO ₂ CH ₃	CONHC ₆ H ₅	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
142	SO ₂ CH ₃	CONHCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
143	SO ₂ CH ₃	CF ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	H	H	-
144	SO ₂ CH ₃	CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
145	SO ₂ CH ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
146	SO ₂ CH ₃	CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	H	H	-

30

40

【 0 0 7 5 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
147	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
148	SO ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
149	SO ₂ CH ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
150	SO ₂ CH ₃	CF ₃	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
151	SO ₂ CH ₃	CF ₂ H	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
152	SOCH ₃	CF ₃	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
153	SOCH ₃	CN	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
154	SO ₂ CH ₃	CF ₃	H	H	R	H	H		H	H	1		H	H	H	H	O
155	SO ₂ CH ₃	CN	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	H	H	O

10

20

【 0 0 7 6 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
156	SO ₂ CH ₃	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	CH ₃	H	O
157	SO ₂ CH ₃	CH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	CH ₃	H	O
158	SO ₂ CH ₃	CN	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	CH ₃	H	O
159	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2		H	H	CH ₃	H	-
160	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2		F	H	CH ₃	H	-
161	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		F	H	CH ₃	H	O
162	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		CH ₃	H	F	H	O
163	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		CH ₃	H	H	H	O
164	SO ₂ CH ₃	CN	H	H	rac	H	H		H	H	1		CH ₃	H	H	H	O

30

40

【 0 0 7 7 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
165	SO ₂ CH ₃	OCH ₂ C≡CH	H	H	rac	H	H		H	H	1		CH ₃	H	H	H	O
166	SO ₂ CH ₃	C(CH ₃) ₃	H	H	rac	H	H		H	H	1		CH ₃	H	H	H	O
167	CN	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H	1		CH ₃	H	H	H	O
168	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	H	H	-
169	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		CH ₃	CH ₃	1		CH ₃	H	H	H	O
170	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		C ₆ H ₅	H	1	rac	H	H	H	H	O
171	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	OH	H	rac	H	H	1		H	H	H	H	-
172	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	OCH ₃	H	rac	H	H	1		H	H	H	H	-
173	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	OCH ₃	H	-

10

20

【 0 0 7 8 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
174	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2		H	OCH ₃	OCH ₃	H	-
175	SO ₂ CH ₃	COOH	H	H	rac	H	H		H	H	2		H	OCH ₃	OCH ₃	H	-
176	SO ₂ CH ₃	CONH ₂	H	H	rac	H	H		H	H	2		H	OCH ₃	OCH ₃	H	-
177	SO ₂ CH ₃	COOCH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	2		H	OCH ₃	OCH ₃	H	-
178	SO ₂ CH ₃	COOH	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	OCH ₃	H	-
179	SO ₂ CH ₃	COOCH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	OCH ₃	H	-
180	SO ₂ CH ₃	CONH ₂	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	OCH ₃	H	-
181	SO ₂ CH ₃	CONH ₂	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	OCH ₃	OCH ₃	H	-
182	CN	COOH	H	H	rac	H	H		H	H	1		CH ₃	H	H	H	O

30

40

【 0 0 7 9 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
183	CN	CONH ₂	H	H	rac	H	H		H	H	1		CH ₃	H	H	H	O
184	CN	COOCH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	1		CH ₃	H	H	H	O
185	SO ₂ CH ₃	COOH	H	H	rac	H	H		H	H	1		CH ₃	H	H	H	O
186	SO ₂ CH ₃	CONH ₂	H	H	rac	H	H		H	H	1		CH ₃	H	H	H	O
187	SO ₂ CH ₃	COOCH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	1		CH ₃	H	H	H	O
188	SO ₂ CH ₃	COOCH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	1		F	H	H	H	O
189	SO ₂ CH ₃	CONHCH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	1		F	H	H	H	O
190	SO ₂ CH ₃	CONH ₂	H	H	rac	H	H		H	H	1		F	H	H	H	O
191	SO ₂ CH ₃	COOH	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-

10

20

【 0 0 8 0 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
192	SO ₂ CH ₃	COOCH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
193	SO ₂ CH ₃	COOCH ₂ CH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
194	SO ₂ CH ₃	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
195	SO ₂ CH ₃	COOCH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
196	SO ₂ CH ₃	CON(CH ₂ CH ₃) ₂	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
197	SO ₂ CH ₃	CONH ₂	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
198	SO ₂ CH ₃	CON(CH ₃) ₂	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
199	SO ₂ CH ₃	CONHcyp _{prop}	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
200	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H	2		H	H	CH ₃	H	-

30

40

【 0 0 8 1 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
201	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H	1		H	H	CH ₃	H	O
202	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H	1		H	H	H	H	O
203	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H				0		H	H	H	H	-CH ₂ -O
204	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H				0		H	H	Br	H	-CH ₂ -O-
205	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H				0		H	H	CH=CH ₂	H	-CH ₂ -O-
206	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H				0		H	H	C≡CH	H	-CH ₂ -O-
207	SO ₂ CH ₃	COOH	H	H	rac	H	H				0		H	H	H	H	-CH ₂ -O-
208	SO ₂ CH ₃	CONH ₂	H	H	rac	H	H				0		H	H	H	H	-CH ₂ -O-
209	CN	H	H	H	rac	H	H				0		H	H	H	H	-CH ₂ -O-

10

20

【 0 0 8 2 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
210	CF ₃	H	H	H	rac	H	H				0		H	H	H	H	-CH ₂ -O-
211	CF ₃	CN	H	H	rac	H	H				0		H	H	H	H	-CH ₂ -O-
212	CN	CN	H	H	rac	H	H				0		H	H	H	H	-CH ₂ -O-
213	CN	CF ₃	H	H	rac	H	H				0		H	H	H	H	-CH ₂ -O-
214	CH ₃	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
215	CF ₂ H	H	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
216	CHF-C ₆ H ₅	H	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
217	OC ₆ H ₅	H	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
218	OCH ₂ C≡ CCH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-

30

40

【 0 0 8 3 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
219	OCH ₂ C≡CH	H	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
220	OCH ₂ CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
221	OCH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
222	OCH ₂ CF ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
223	CH ₃	CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
224	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
225	SOCH ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
226	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
227	OCH(CH ₃)C≡CH	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-

10

20

【 0 0 8 4 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
228	CH ₂ C ₆ H ₄ -4-Cl	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
229	OC ₆ H ₅	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
230	OCH ₂ C≡CH	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
231	OCH ₂ CH ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
232	OCH ₂ C ₆ H ₅	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
233	OCH ₃	H	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
234	OCH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
235	OCH ₃	CONH ₂	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
236	CONH ₂	CONH ₂	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-

30

40

【 0 0 8 5 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
237	SCF ₃	CONH ₂	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
238	S(O) ₂ CF ₃	CONH ₂	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
239	OC ₆ H ₅	CONH ₂	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
240	OCH ₃	COOCH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
241	OCH ₃	COOH	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
242	OCH ₂ CH ₃	CN	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
243	OCH ₃	CN	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
244	OCH ₂ C≡CH	CN	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
245	NO ₂	CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-

10

20

【 0 0 8 6 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
246	NO ₂	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
247	NO ₂	CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	H	H	-
248	NO ₂	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	1		H	H	H	H	-
249	NO ₂	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
250	NO ₂	CH ₃	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	CH ₃	H	-
251	NO ₂	CH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	2		CH ₃	H	CH ₃	H	-
252	NO ₂	CH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	1		CH ₃	H	H	H	O
253	NO ₂	CH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	1		F	H	H	H	O
254	NO ₂	CH ₃	H	H	rac	H	H		H	H	2		F	H	H	H	-

30

40

【 0 0 8 7 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
255	SCH ₃	CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
256	CF ₃	OH	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
257	CF ₃	CH ₃	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
258	SO ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
259	SO ₂ CH ₃	OH	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
260	SO ₂ CH ₃	OH	CONH ₂	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
261	SO ₂ CH ₃	CH ₃	CONH ₂	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
262	SO ₂ CH ₃	CH ₃	CN	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-
263	SO ₂ CH ₃	OH	CN	H	R	CH ₃	H	S	H	H	1		H	H	CH ₃	H	-

10

20

【 0 0 8 8 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
264	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	CH ₃	CH ₃		H	H	1		H	H	H	H	-
265	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	-CH ₂ -CH ₂ -			H	H	1		H	H	H	H	-
266	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	CH ₂ C H ₃	CH ₂ C H ₃		H	H	1		H	H	H	H	-
267	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	H	H	C=O
268	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	H	H	CHCH ₃
269	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	H	H	NCH ₃
270	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	H	H	NH
271	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	1		H	H	H	H	C(CH ₃) ₂
272	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H				0		H	H	H	H	-CH ₂ -S-

30

40

【 0 0 8 9 】

No.	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ³	St N R ³	R ⁴	R ⁵	St R ⁴ R ⁵	R ⁶	R ⁷	n	St R ⁶ R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
273	SO ₂ CH ₃	H	H	H	R	H	H		H	H	2		H	H	H	H	-
274	SO ₂ CH ₃	H	H	H	rac	H	H		H	H	2		F	H	H	H	-

【0090】

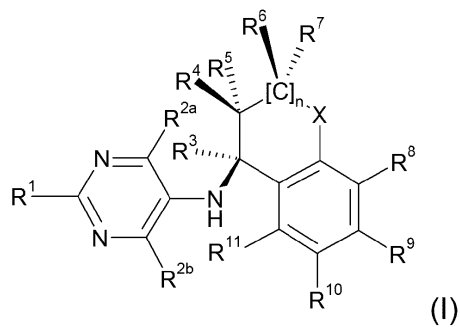
本発明は、さらに、一般式（I）で表される対応する化合物及び／又はその塩及び／又はその農薬的に許容される4級化された窒素誘導体を調製するための調製方法も提供する。

10

【0091】

（a.） 一般式（I）

【化5】

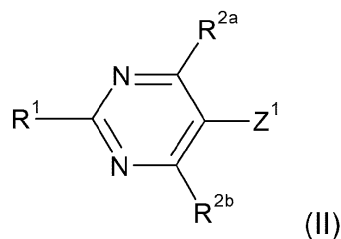


20

【0092】

〔式中、ラジカルR¹～R¹¹及びX、並びに、さらに、nは、上記意味を有する〕で表される化合物を調製するために、一般式（II）

【化6】

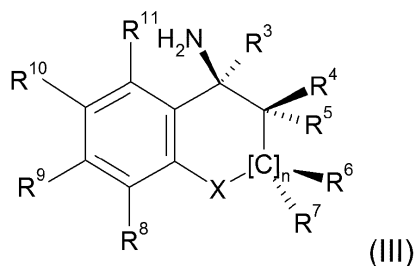


30

【0093】

〔式中、R¹及びR^{2a}及びさらにR^{2b}は、上記意味を有し、並びに、Z¹は、交換可能なラジカル又は脱離基である〕で表される化合物を一般式（III）

【化7】



40

【0094】

〔式中、ラジカルR³～R¹¹及びX、並びに、さらに、nは、上記意味を有する〕で表されるアミン又は一般式（III）で表されるアミンの酸付加塩と反応させる。

50

【0095】

交換可能なラジカル Z^1 又は脱離基 Z^1 は、特に、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 (C_1-C_4) -アルキルスルホニル、置換されていないか若しくは置換されているフェニル- (C_1-C_4) -アルキルスルホニル又は (C_1-C_4) -アルキルフェニルスルホニルである。

【0096】

Z^1 に関する脱離基として特に好ましいものは、臭素、塩素又はフッ素である（「A. 合成実施例」（特に、Ex. 64、Ex. 92、Ex. 115及びEx. 273）を参照されたい）。

【0097】

一般式（I I）で表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法によって調製することができる。場合により、式（I I）〔式中、 R^{2a} は $COOH$ である〕で表される化合物を使用することも可能であり、この場合、その $COOH$ を選択された反応条件下で脱カルボキシルし、水素に変換する。場合により、式（I I）〔式中、 R^{2a} は $COOR^{2aa}$ であり、ここで、 R^{2aa} は (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -アルキルフェニル又はエステルを形成する別の基である〕で表される化合物を使用し、次いで、その $COOR^{2aa}$ を選択された条件下でその場で加水分解するか又は引き続いて加水分解し、 $R^{2a}=COOH$ に変換し、次いで、その $COOH$ 基を脱カルボキシルし、及び、水素に変換することも可能である。

【0098】

上記反応は、さまざまな補助剤によって、例えば、試薬リン酸カリウム、ヨウ化銅（I）及びN, N-ジエチル-2-ヒドロキシベンズアミドによって、触媒することも可能であり、又は、Buchwald-Hartwigカップリングの意味において、特定の遷移金属触媒系によって触媒することも可能である。

【0099】

例えば、2-メチルチオ-5-クロロピリミジン-4-カルボン酸類は、ムクロロ酸とS-メチルチウロニウムスルフェートから調製することが可能であり（Liang, Yong-min, Luo, Sheng-jun, Zhang, Zhao-xin and Yong-xiang (2002) "EFFICIENT SYNTHESIS OF A NEW PYRIMIDINE DERIVATIVE", Synthetic Communications, 32:1, 153-157, <http://dx.doi.org/10.1081/SCC-120001523>）、次いで、酸化して、メタンスルホニル誘導体とすることができる。同様にして、ムコブrom酸を使用することも可能である（Collect. Czech. Chem. Commun. 1949, 14, 223; Tetrahedron. Lett. 1976, 693）。

【0100】

一般式（I I I）で表されるアミン又はその酸付加塩は、市販されているか、又は、それらの合成については、WO 2004/069814 A1に記載されている。

【0101】

(b.) 場合により、WO 2004/92166 A2（第68頁）に記載されている調製方法と同様にして、5-アミノピリミジン類を市販されているか又は既知方法で調製することが可能なケトンと反応させ、そして、水素化して（例えば、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウムで水素化して）、式（I）に対応する化合物を生成させることができる。

【0102】

場合により、該反応は、最初に、該アミンを市販されているか又は既知方法で調製することが可能なケトンと反応させてイミンを生成させ、次いで、そのようにして得られた中間体を水素化することにより、2つの独立した部分的な段階で実施することも可能である。

【0103】

(c.) 一般式 (I) で表される化合物を調製するために、化合物を前駆物質として使用することが可能であり、及び、それらを本発明による別の化合物に変換することが可能である。

【0104】

(1) 例えば、式 (I) [式中、 R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 又は $R^{10} = Hal$ (特に、ヨウ素又は臭素)] で表される誘導体は、遷移金属触媒下で、例えば、プロトン性又は非プロトン性の溶媒の中のビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (II) クロリドを用いて、及び、塩基を添加して、20～150℃の温度でアセチレン又はトリメチルシリルで保護されているアセチレンと反応させて、式 (I) [式中、 R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 又は $R^{10} = アルキニル$] で表される化合物を生成させることができる。

10

【0105】

(2) 例えば、式 (I) [式中、 R^1 又は R^{2a} 又は $R^{2b} = CN$] で表される誘導体は、酸触媒下又は塩基触媒下で加水分解することが可能であり、このようにして得られたカルボン酸は、既知プロセスによって酸塩化物に変換することが可能であり、そして、今度はこれらを、アミドに変換することが可能である。

【0106】

(3) 例えば、式 (I) [式中、 R^1 又は R^{2a} 又は $R^{2b} = Hal$ (特に、塩素又は臭素)、又は、 SO_2Me 、又は、 $(C_1 - C_6) - アルキルスルホニル$ 若しくはフェニル $(C_1 - C_6) - アルキルスルホニル$] で表される誘導体は、プロトン性又は非プロトン性の溶媒の中で、100～200℃の温度で塩基を添加して、アルコキシド又はアミンと反応させることによって、式 (I) [式中、 R^1 又は R^{2a} 又は $R^{2b} = アルコシアルキル$ 又はアミノアルキル又はジアミノアルキル] で表される化合物に変換することができる。

20

【0107】

(4) 例えば、式 (I) [式中、 R^1 又は R^{2a} 又は $R^{2b} = COOH$] で表される誘導体は、酸塩化物又は混合無水物に変換し、次いで、アルコール又はアミンと反応させて、対応するカルボン酸エステル又はアミドを生成させることができる。

【0108】

(5) 例えば、式 (I) [式中、 R^1 又は R^{2a} 又は $R^{2b} = CONH_2$] で表される誘導体は、オキシ塩化リンを用いて脱水することによって、対応するニトリルに変換することができる。

30

【0109】

(6) 例えば、式 (I) [式中、 R^1 又は R^{2a} 又は $R^{2b} = SO_2Me$ 又は $(C_1 - C_6) - アルキルスルホニル$ 又はフェニル $(C_1 - C_6) - アルキルスルホニル$] で表される誘導体は、ホルムアニリドを用いて (cf. : Ihara Chem Ind (T SUB) J6-2099305 and J6-2106084)、対応するアニリドに変換することができる。

【0110】

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

40

【0111】

反応及び後処理の並行的な実施に関しては、多くの市販されている機器、例えば、「Barnstead International, Dubuque, Iowa 52

50

004-0797, USA」製の「Calypso reaction blocks」又は「Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB11 3AZ, England」製の反応ステーション又は「PerkinElmer, Waltham, Massachusetts 02451, USA」製の「MultiPROBE Automated Workstation」などを使用することが可能である。一般式(I)で表される化合物及びそれらの塩の並行精製又は調製の過程で生じる中間体の並行精製に関しては、利用可能な装置としては、クロマトグラフィー装置、例えば、「ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA」製のクロマトグラフィー装置などがある。

10

【0112】

上記装置は、個々の作業段階が自動化されているモジュール式方法をもたらすが、作業段階の間では手動による操作を行わなければならない。これは、個々の自動化モジュールが例えばロボットによって操作される部分的に又は完全に一体化された自動化システムを用いて回避することができる。このタイプの自動化システムは、例えば、「Caliper, Hopkinton, MA 01748, USA」から購入することができる。

【0113】

単一又は複数の合成段階の実施は、ポリマー担持試薬／スカベンジャー樹脂を使用することにより補助することができる。専門的な文献（例えば、「ChemFiles, Vol. 4, No. 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis (Sigma-Aldrich)」）には、一連の実験プロトコルが記載されている。

20

【0114】

ここに記載されている方法に加えて、一般式(I)で表される化合物及びそれらの塩は、固相担持方法(solid-phase supported method)によって部分的に又は完全に調製することが可能である。この目的のために、当該合成における個々の中間体若しくは全ての中間体、又は、対応する手順に適合させた合成における個々の中間体若しくは全ての中間体を、合成用樹脂に結合させる。固相担持合成方法は、技術文献、例えば、「Barry A. Bunin in "The Combinatorial Index", Academic Press, 1998」及び「Combinatorial Chemistry - Synthesis, Analysis, Screening (editor: Gunther Jung), Wiley, 1999」に十分に記載されている。固相担持合成方法を使用することで、文献から知られている多くのプロトコルを実施することが可能となり、そして、これらも、手動で又は自動化された方法で実施することができる。該反応は、例えば、「Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA 92064, USA」製のマイクロ反応器の中でIRORI技術を用いることによって、実施することができる。

30

40

【0115】

固相及び液相のいずれにおいても、個々の合成段階又は幾つかの合成段階は、マイクロ波技術を使用することにより補助することができる。専門文献（例えば、「Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry (editor: C. O. Kappe and A. Stadler), Wiley, 2005」）には、一連の実験プロトコルが記載されている。

【0116】

ここに記載されている調製方法で調製することによって、式(I)で表される化合物及びそれらの塩が、ライブラリーと称される物質コレクションの形態で得られる。本発明は、式(I)で表される少なくとも2種類の化合物及びそれらの塩を含んでいるライブラリ

50

ーも提供する。

【0117】

一般式 (I) で表される化合物は除草特性を有しているので、本発明は、さらに、有害な植物を防除する為の除草剤としての、本発明による一般式 (I) で表される化合物の使用も提供する。

【0118】

除草剤は、栽培のさまざまな段階において、農業上利用される作物の中で使用される。かくして、一部の製品の施用は、播種前又は播種中においてさえ実施される。別の製品は、作物植物が出芽する前に、即ち、実生が地表面を通して出現する前に、施用される（発生前処理除草剤）。最後に、当該作物植物によって子葉又は普通葉が既に形成されている場合には、発生後処理除草剤が使用される。

10

【0119】

ここで、本発明による化合物は、発生前と発生後のいずれにおいても使用することが可能であるが、本発明による化合物は、発生前で使用するのが好ましい。

【0120】

発生前処理には、耕作区域への播種前の処理（*pp i* = 播種前混和（*pre plant incorporation*））と成長した植物が未だ見られない播種された耕作区域への処理の両方が包含される。

【0121】

本発明による式 (I) で表される化合物及びそれらの塩（これらは、同義語として、以下では、ともに、「式 (I) で表される化合物」と称される）は、広範囲の経済的に重要な単子葉及び双子葉の有害植物に対して優れた除草効力を示す。該活性化合物は、根茎、根株又は別の多年生器官から苗条を生じる、防除が困難な多年生有害植物も、良好に防除する。ここで、上記物質が、播種前方法、発生前方法又は発生後方法で施用されるかどうかは重要ではない。

20

【0122】

本発明による一般式 (I) で表される化合物によって防除することが可能な何種類かの代表的な単子葉雑草植物相及び双子葉雑草植物相の具体的な例を挙げることができるが、そのように列挙されたものは、特定の種に限定されるものではない。

【0123】

単子葉雑草種における、主に、一年生の群のヌカボ属（*Agrostis*）、スズメノテッポウ属（*Alopecurus*）、セイヨウヌカボ属（*Apera*）、カラスムギ属（*Avena*）、ビロードキビ属（*Brachiaria*）、スズメノチャヒキ属（*Bromus*）、タツノツメガヤ属（*Dactyloctenium*）、メヒシバ属（*Digitaria*）、ヒエ属（*Echinochloa*）、ハリイ属（*Eleocharis*）、オヒシバ属（*Eleusine*）、ウシノケグサ属（*Festuca*）、テンツキ属（*Fimbristylis*）、カモノハシ属（*Ischaemum*）、ドクムギ属（*Lolium*）、ミズアオイ属（*Monochoria*）、キビ属（*Panicum*）、スズメノヒエ属（*Paspalum*）、クサヨシ属（*Phalaris*）、アワガエリ属（*Phleum*）、イチゴツナギ属（*Poa*）、オモダカ属（*Sagittaria*）、ホタルイ属（*Scirpus*）、エノコログサ属（*Setaria*）、ナガボノウルシ属（*Sphenoclea*）の各種、及び、さらに、カヤツリグサ属（*Cyperus*）の各種、並びに、多年生種に関して、カモジグサ属（*Agropyron*）、ギョウギシバ属（*Cynodon*）、チガヤ属（*Imperata*）及びモロコシ属（*Sorghum*）の各種、及び、さらに、多年生のカヤツリグサ属（*Cyperus*）の各種が、良好に防除される。

30

40

【0124】

双子葉雑草種の場合、その作用スペクトルは、一年生のヤエムグラ属（*Galium*）、スミレ属（*Viola*）、クワガタソウ属（*Veronica*）、オドリコソウ属（*Lamium*）、ハコベ属（*Stellaria*）、ヒユ属（*Amaranthus*）、シ

50

ロガラシ属 (*Sinapis*)、サツマイモ属 (*Ipomoea*)、シカギク属 (*Matricaria*)、イチビ属 (*Abutilon*) 及びキンゴジカ属 (*Sida*)、並びに、多年生雑草におけるセイヨウヒルガオ属 (*Convolvulus*)、アザミ属 (*Cirsium*)、ギシギシ属 (*Rumex*) 及びヨモギ属 (*Artemisia*) などの種に及ぶ。さらに、ブタクサ属 (*Ambrosia*)、カミツレ属 (*Anthemis*)、ヒレアザミ属 (*Carduus*)、ヤグルマギク属 (*Centaurea*)、アカザ属 (*Chenopodium*)、アザミ属 (*Cirsium*)、セイヨウヒルガオ属 (*Convolvulus*)、チョウセンアサガオ属 (*Datura*)、エメキス属 (*Emex*)、チシマオドリコソウ属 (*Galeopsis*)、コゴメギク属 (*Galinsoga*)、マメグンバイナズナ属 (*Lepidium*)、アゼトウガラシ属 (*Lindernia*)、ケシ属 (*Papaver*)、スベリヒユ属 (*Portulaca*)、タデ属 (*Polygonum*)、キンポウゲ属 (*Ranunculus*)、イヌガラシ属 (*Rorippa*)、キカシグサ属 (*Rotala*)、キオン属 (*Senecio*)、セスバニア属 (*Sesbania*)、ナス属 (*Solanum*)、ノゲシ属 (*Sonchus*)、タンポポ属 (*Taraxacum*)、シャジクソウ属 (*Trifolium*)、イラクサ属 (*Urtica*) 及びオナモミ属 (*Xanthium*) などの双子葉雑草の場合においても、除草効果が観察される。

10

【0125】

本発明による一般式 (I) で表される化合物が発芽前に土壌表面に施用される場合、雑草の実生の出芽が完全に防止されるか、又は、雑草は、子葉期に達するまで成長するが、その後成長を停止し、そして最終的には、3～4週間経過した後、完全に枯死する。

20

【0126】

一般式 (I) で表される活性化合物が植物の緑色の部分に発生後施用される場合は、その処理後、極めて短い時間が経過した後、その成長は同様に完全に停止し、そして、当該雑草植物は、施用時点における成長段階にとどまるか、又は、一定期間の後、完全に枯死し、その結果、このようにして、作物植物にとって有害である雑草との競合が、極めて早期に持続的に排除される。

【0127】

本発明による一般式 (I) で表される化合物は、単子葉雑草及び双子葉雑草に対して優れた除草活性を示すが、経済的に重要な作物の作物植物、例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、イネ、トウモロコシ、テンサイ、ワタ、ナタネ及びダイズなどは、ほんの僅かにしか損傷をうけないか、又は、全く損傷を受けない。このような理由で、本発明の化合物は、農業上有用な植物における望ましくない植物の成長を選択的に防除するのに非常に適している。

30

【0128】

さらに、本発明による一般式 (I) で表される物質は、作物植物において優れた成長調節特性を有する。それらは、調節的なやり方で植物の代謝に関与し、従って、植物の成分に対して標的化された方法で影響を及ぼすために、並びに、例えば乾燥及び成長阻害を誘発することによって、収穫を促進するために、使用することができる。さらに、それらは、その過程において植物を枯死させることなく植物の望ましくない成長を全体的に制御及び阻害するのにも適している。植物の成長を阻害することは、それによって倒伏が低減され得るか又は完全に防止され得るので、多くの種類の単子葉作物及び双子葉作物において重要な役割を果たす。

40

【0129】

本発明の活性化合物は、その除草特性及び植物成長調節特性によって、既知遺伝子組換え植物又は今後開発されるであろう遺伝子組換え植物の作物の中の有害な植物を防除するために用いることもできる。概して、トランスジェニック植物は、特有の有利な特性に関して、例えば、特定の殺有害生物剤（特に、特定の除草剤）に対する抵抗性、植物病害又は植物病害の原因となる生物（例えば、特定の昆虫類又は微生物、例えば、菌類、細菌類又はウイルス類）に対する抵抗性に関して、注目すべきである。別の特別な特性は、収穫

50

物の、例えば、量、質、貯蔵性、組成及び特定の成分に関する。例えば、デンプン含有量が増大されているか若しくはデンプンの質が変性されている既知トランスジェニック植物、又は、収穫物が異なった脂肪酸組成を有している既知トランスジェニック植物が、存在している。別の特定の特性は、非生物的なストレス（例えば、熱さ、低温、渇水、塩分及び紫外線など）に対する耐性又は抵抗性であり得る。

【0130】

本発明による一般式（I）で表される化合物又はそれらの塩は、有用な植物及び観賞植物の経済的に重要なトランスジェニック作物、例えば、穀物（例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、カラスムギ、ソルガム及びアワ、イネ、キャッサバ及びトウモロコシ）の経済的に重要なトランスジェニック作物において、又は、テンサイ、ワタ、ダイズ、ナタネ、ジャガイモ、トマト、エンドウ及び他の野菜類の作物において、使用するのが好ましい。

10

【0131】

好ましくは、一般式（I）で表される化合物は、除草剤として、当該除草剤の植物毒性効果に対して抵抗性であるか又は組換え手段によって抵抗性にされた有用な植物の作物の中で使用することができる。

【0132】

既存の植物と比較して改質された特性を有する新規植物を生成させる慣習的な方法は、例えば、従来の育種法及び突然変異体の生成である。別法として、変更された特性を有する新規植物は、組換え法を用いて生成させることができる（例えば、EP 0221044、EP 0131624を参照されたい）。例えば、以下のことは、いくつかの場合において記載されている：

20

- ・ 植物体内で合成されるデンプンを改質することを目的とする作物植物の遺伝子組換え（例えば、WO 92/011376、WO 92/014827、WO 91/019806）；

- ・ グルホシネートタイプの特定の除草剤に対して抵抗性を示すトランスジェニック作物植物（c f. 例えば、EP 0242236、EP 0242246）、又は、グリホセートタイプの特定の除草剤に対して抵抗性を示すトランスジェニック作物植物（WO 92/000377）、又は、スルホニル尿素タイプの特定の除草剤に対して抵抗性を示すトランスジェニック作物植物（EP 0257993、US 5, 013, 659）；

30

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

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

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

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

40

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

- ・ より多い収穫量又はより優れた品質によって区別されるトランスジェニック作物植物；

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

【0133】

改質された特性を有する新規トランスジェニック植物を産生させることができる多くの分子生物学的技術は、原則として知られている；例えば、以下のものを参照されたい：「I. Potrykus and G. Spangenberg (eds.) Ge

50

ne Transfer to Plants, Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg」、又は、「Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431」。

【0134】

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

【0135】

例えば、遺伝子産物の活性が低下した植物細胞の生成は、少なくとも1の対応するアンチセンスRNA、コサプレッション効果を達成するためのセンスRNAの発現によって、又は、前記遺伝子産物の転写産物を特異的に切断する少なくとも1の適切に構築されたりボザイムの発現によって、達成することができる。

【0136】

この目的のために、存在し得る全てのフランキング配列を含む、遺伝子産物の全コード配列を含んでいるDNA分子、及び、さらに、コード配列の一部分（ここで、これらの部分は、細胞内においてアンチセンス効果を有するのに十分なほど長いことが必要である）だけを含んでいるDNA分子を使用することが可能である。さらにまた、遺伝子産物のコード配列と高度に相同性を有するが、それらと完全に同一なわけではないDNA配列を用いることもできる。

【0137】

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

【0138】

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

【0139】

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

【0140】

本発明による一般式（I）で表される化合物は、成長調節剤（例えば、ジカンバ）に対して抵抗性を示すトランスジェニック作物の中で、又は、必須植物酵素（例えば、アセト

10

20

30

40

50

乳酸シンターゼ（ALS）、EPSシンターゼ、グルタミンシンターゼ（GS）又はヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ（HPPD）を阻害する除草剤に対して抵抗性を示すトランスジェニック作物の中で、又は、スルホニル尿素類、グリホセート、グルホシネート若しくはベンゾイルイソオキサゾール類及び類似した活性物質からなる群から選択される除草剤に対して抵抗性を示すトランスジェニック作物の中で、使用するの
10

【0141】

本発明による一般式（I）で表される活性化合物をトランスジェニック作物の中で使用する
場合、他の作物において観察され得る有害植物に対する効果に加えて、当該トランス
ジェニック作物における施用に対して特異的な効果、例えば、防除可能な雑草の範囲の変
更又は特定の拡大、施用に使用し得る施用量の変更、好ましくはトランスジェニック作
物が抵抗性を示す除草剤との良好な適合性、並びに、当該トランスジェニック作物植物の
成長及び収穫量に対する効果などがしばしば観察される。

【0142】

従って、本発明は、さらにまた、トランスジェニック作物植物の中で有害な植物を防除
するための除草剤としての、本発明による一般式（I）で表される化合物の使用にも関す
る。

【0143】

一般式（I）で表される化合物は、生物学的及び／又は物理化学的パラメータが要求さ
れるさまざまな方法で製剤することができる。可能な製剤としては、例えば、以下のもの
を挙げることができる：水和剤（WP）、水溶剤（water-soluble pow
ders）（SP）、水溶性濃厚剤（water-soluble concentra
tes）、乳剤（EC）、エマルジョン剤（EW）、例えば、水中油型エマルジョン剤及
び油中水型エマルジョン剤、散布可能溶液剤（sprayable solutions
）、懸濁製剤（SC）、油性分散液剤又は水性分散液剤、油混和性溶液剤、カプセル懸濁
製剤（capsule suspensions）（CS）、散粉性製品（dust in
g products）（DP）、種子粉衣性製品（seed-dressing pr
oducts）、ばらまき用顆粒剤（granules for scattering
）及び土壌施用用顆粒剤、微粒剤の形態にある顆粒剤（GR）、噴霧粒剤（spray
granules）、被覆粒剤（coated granules）及び含浸粒剤（ad
sorption granules）、顆粒水和剤（WG）、水溶性粒剤（SG）、微
量散布製剤、マイクロカプセル剤、並びに、蠟剤（waxes）。
20
30

【0144】

これらの個々の製剤型は原則として知られており、そして、例えば、以下のものに記載
されている：「Winnacker-Kuchler, “Chemische Tec
hnologie” [Chemical technology], Volume 7
, C. Hanser Verlag Munich, 4. ed. 1986」、「
Wade van Valkenburg, “Pesticide Formulat
ions”, Marcel Dekker, N. Y., 1973」、「K. Ma
rtens, “Spray Drying” Handbook, 3rd ed.
1979, G. Goodwin Ltd. London」。
40

【0145】

不活性物質、界面活性剤、溶媒及びさらなる添加剤などの欠くことのできない製剤助剤
も知られており、そして、例えば、以下のものに記載されている：「Watkins,
“Handbook of Insecticide Dust Diluents a
nd Carriers”, 2nd ed., Darland Books, Ca
ldwell N. J.」、「H. v. Olphen, “Introduc
tion to Clay Colloid Chemistry”; 2nd ed., J.
Wiley & Sons, N. Y.」、「C. Marsden, “Solve
nts Guide”; 2nd ed., Interscience, N. Y.
50

1963」、「McCUTCHEON'S "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N. J.」、「Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N. Y. 1964」、「Schonfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte" [Interface-active Ethylene Oxide Adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976」、「Winacker-Kuchler, "Chemische Technologie" [Chemical Technology], volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th ed. 1986」。

10

【0146】

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

【0147】

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

20

【0148】

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

30

【0149】

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

40

【0150】

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

【0151】

エマルジョン剤、例えば、水中油型エマルジョン剤（EW）は、例えば、水性有機溶媒を使用し、そして、適切な場合には界面活性剤（例えば、別の製剤型に関連して既に上記

50

で挙げられている界面活性剤)を使用して、攪拌機、コロイドミル及び／又はスタティックミキサーを用いて調製することができる。

【0152】

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

【0153】

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

【0154】

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

【0155】

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

【0156】

該農薬製剤は、一般に、0.1～99重量%、特に、0.1～95重量%の式(I)で表される活性化合物を含有する。

【0157】

水和剤では、該活性化合物の濃度は、例えば、約10～90重量%であり、100重量%までの残余は、慣習的な製剤成分からなる。乳剤の場合、該活性化合物の濃度は、約1～90重量%、好ましくは5～80重量%であり得る。粉剤型の製剤は、1～30重量%の活性化合物、好ましくは、通常、5～20重量%の活性化合物を含み；散布可能溶液剤は、約0.05～80重量%、好ましくは、2～50重量%の活性化合物を含む。顆粒水和剤の場合は、該活性化合物の含有量は、当該活性化合物が液体形態で存在しているか又は固体形態で存在しているかに部分的に依存し、及び、どのような造粒助剤、増量剤などが使用されるかに部分的に左右される。水中で分散可能な顆粒剤では、活性化合物の含有量は、例えば、1～95重量%、好ましくは10～80重量%である。

【0158】

さらに、活性化合物の上記製剤は、場合により、それぞれの慣習的な接着剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、浸透剤、防腐剤、不凍剤、並びに、溶媒、増量剤、担体、並びに、色素、消泡剤、蒸発抑制剤、並びに、pH及び粘度に影響を及ぼす作用剤を含有する。

【0159】

一般式(I)で表される化合物又はその塩は、それだけで、又は、別の殺有害生物活性化合物、例えば、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤、殺菌剤、薬害軽減剤、肥料及び／又は成長調節剤などと組み合わされた調製物(製剤)の形態で、例えば、完成した製剤

10

20

30

40

50

として又はタンクミックスとして、使用することも可能である。

【0160】

混合された製剤中で又はタンクミックスの中で本発明による化合物と組合せて使用することが可能な活性化合物は、例えば、「Weed Research 26 (1986) 441-445」又は「The Pesticide Manual», 15th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2006」及びそれらの中で引用されている文献に記載されている、例えば、アセト乳酸シンターゼ、アセチル-CoAカルボキシラーゼ、セルロースシンターゼ、エノールピルビルシキミ酸-3-リン酸シンターゼ、グルタミンシンターゼ、p-ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ、フィトエンデサチュラーゼ、光化学系I、光化学系II、プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼなどを阻害することに基づく、例えば、既知活性化合物である。本発明による化合物と組み合わせることが可能な既知除草剤又は既知植物成長調節剤は、例えば、以下の活性化合物である（ここで、該化合物は、国際標準化機構（ISO）に従う「一般名」で示されているか、又は、化学名で示されているか、又は、コード番号で示されている）。それらは、たとえ明示的に言及されていなくても、常に、全ての施用形態（例えば、酸、塩、エステル）、及び、さらに、全ての異性体形態（例えば、立体異性体及び光学異性体）を包含する。

【0161】

混合相手除草剤の例は、以下のとおりである：

アセトクロル、アシフルオルフェン、アシフルオルフェン-ナトリウム、アクロニフェン、アラクロール、アリドクロール、アロキシジム、アロキシジム-ナトリウム、アメトリン、アミカルバゾン、アミドクロル、アミドスルフロン、アミノシクロピラクロル、アミノシクロピラクロルーカリウム、アミノシクロピラクロルーメチル、アミノピラリド、アミトロール、スルファミン酸アンモニウム、アニロホス、アスラム、アトラジン、アザフェニジン、アジムスルフロン、ベフルブタミド、ベナゾリン、ベナゾリン-エチル、ベンフルラリン、ベンフレセート、ベンスルフロン、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、ピラナホス-ナトリウム、ビスピリバック、ビスピリバック-ナトリウム、ブロマシル、ブロモブチド、ブロモフェノキシム、ブロモキシニル、ブソキシノン (b u s o x i n o n e)、ブタクロール、ブタフェナシル、ブタミホス、ブテナクロール、ブトラリン、ブトロキシジム、ブチレート、カフェンストロール、カルベタミド、カルフェントラゾン、カルフェントラゾン-エチル、クロランベン、クロルブロムロン、クロルフェナク、クロルフェナク-ナトリウム、クロルフェンプロップ、クロルフルレノール、クロルフルレノール-メチル、クロリダゾン、クロリムロン、クロリムロン-エチル、クロロフタリム、クロロトルロン、クロルタル-ジメチル、クロルスルフロン、シニドン、シニドン-エチル、シンメチリン、シノスルフロン、クレトジム、クロジナホップ、クロジナホップ-プロパルギル、クロマゾン、クロメプロップ、クロピラリド、クロランスラム、クロランスラム-メチル、クミルロン、シアナミド、シアナジン、シクロエート (c y c l o a t)、シクロスルファムロン、シクロキシジム、シハロホップ、シハロホップ-ブチル、シプラジン、2, 4-D、2, 4-D-ブチル、2, 4-D-ジメチルアンモニウム、2, 4-D-ジオールアミン、2, 4-D-エチル、2, 4-D-2-エチルヘキシル、2, 4-D-イソブチル、2, 4-D-イソオクチル、2, 4-D-イソプロピルアンモニウム、2, 4-D-カリウム、2, 4-D-トリイソプロパノールアンモニウム、2, 4-D-トロールアミン、2, 4-DB、2, 4-DB-ブチル、2, 4-DB-ジメチルアンモニウム、2, 4-DB-イソオクチル、2, 4-DB-カリウム、2, 4-DB-ナトリウム、ダイムロン (d a i m u r o n) ((ダイムロン (d y m r o n))、ダラポン、n-デカノール、デスメジファム、デトシル-ピラゾレート (DTP)、ジカンバ、ジクロベニル、ジクロルプロップ、ジクロルプロップ-P、ジクロホップ、ジクロホップ-メチル、ジクロホップ-P-メチル、ジクロスラム

、ジフェンゾコート、ジフルフェニカン、ジフルフェンゾピル、ジフルフェンゾピルーナトリウム、ジメフロソ、ジメピペレート、ジメタクロール、ジメタメトリン、ジメテナミド、ジメテナミドーP、ジメトラスルフロソ、ジニトラミン、ジクワット、ジクワットージプロミド、ジチオピル、ジウロン、DNOC、エンドタール、EPTC、エスプロカルブ、エタルフルラリン、エタメトスルフロソ、エタメトスルフロソーメチル、エチオジン、エトフメセート、エトキシフェン、エトキシフェンーエチル、エトキシスルフロソ、エトベンザニド、F-5331、即ち、N-[2-クロロ-4-フルオロ-5-[4-(3-フルオロプロピル)-4, 5-ジヒドロ-5-オキソ-1H-テトラゾール-1-イル]フェニル]エタンスルホンアミド、F-7967、即ち、3-[7-クロロ-5-フルオロ-2-(トリフルオロメチル)-1H-ベンゾイミダゾール-4-イル]-1-メチル-6-(トリフルオロメチル)ピリミジン-2, 4(1H, 3H)-ジオン、フェノキサプロップ、フェノキサプロップーP、フェノキサプロップーエチル、フェノキサプロップーP-エチル、フェノキサスルホン、フェントラザミド、フラムプロップ、フラムプロップーM-イソプロピル、フラムプロップーM-メチル、フラザスルフロソ、フロラスラム、フルアジホップ、フルアジホップーP、フルアジホップーブチル、フルアジホップーP-ブチル、フルカルバゾン、フルカルバゾンーナトリウム、フルセトスルフロソ、フルクロラリン、フルフェナセット(チアフルアミド)、フルフェンピル、フルフェンピルーエチル、フルメツラム、フルミクロラック、フルミクロラックーペンチル、フルミオキサジン、フロオメツロン、フルオログリコフェン、フルオログリコフェンーエチル、フルプロパネート、フルピルスルフロソ、フルピルスルフロソーメチルーナトリウム、フルリドン、フルロクロリドン、フルロキシピル、フルロキシピルーメブチル、フルルタモン、フルチアセット、フルチアセットーメチル、フルチアミド、ホメサフェン、ホラムスルフロソ、ホサミン、グルホシネート、グルホシネートーアンモニウム、グルホシネートーP、グルホシネートーP-アンモニウム、グルホシネートーP-ナトリウム、グリホセート、グリホセートーイソプロピルアンモニウム、グリホセートージアンモニウム、グリホセートージメチルアンモニウム、グリホセートーカリウム、グリホセートーナトリウム、グリホセートートリメシウム、H-9201、即ち、O-(2, 4-ジメチル-6-ニトロフェニル) O-エチルイソプロピルホスホルアミドチオエート、ハロサフェン、ハロスルフロソ、ハロスルフロソーメチル、ハロキシホップ、ハロキシホップーP、ハロキシホップーエトキシエチル、ハロキシホップーP-エトキシエチル、ハロキシホップーメチル、ハロキシホップーP-メチル、尿素硫酸塩(urea sulfate)、ヘキサジノン、HW-02、即ち、1-(ジメトキシホスホリル)-エチルー(2, 4-ジクロロフェノキシ)アセテート、イマザメタベンズ、イマザメタベンズーメチル、イマザモックス、イマザモックスーアンモニウム、イマザピック、イマザピル、イマザピルーイソプロピルアンモニウム、イマザキン、イマザキンーアンモニウム、イマゼタピル、イマゼタピルーアンモニウム、イマゾスルフロソ、インダノファン、インダジフラム、ヨードスルフロソ、ヨードスルフロソーメチルーナトリウム、アイオキシニル、イブフェンカルバゾン、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、KUH-043、即ち、3-([5-(ジフルオロメチル)-1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-イル]メチル)スルホニル)-5, 5-ジメチル-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール、カルブチレート、ケトスピラドックス、ラクトフェン、レナシル、リニュロン、MCPA、MCPB、MCPB-メチル、MCPB-エチル、MCPB-ナトリウム、メコプロップ、メコプロップーナトリウム、メコプロップーブトチル、メコプロップーP-ブトチル、メコプロップーP-ジメチルアンモニウム、メコプロップーP-2-エチルヘキシル、メコプロップーP-カリウム、メフェナセット、メフルイジド、メピコートークロリド、メソスルフロソ、メソスルフロソーメチル、メソトリオン、メタベンズチアズロン、メタム、メタミホップ、メタミトロン、メタザクロール、メタゾスルフロソ(metazasulfuron)、メチオピルスルフロソ(methiopyrsulfuron)、メチオゾリン、イソチオシアン酸メチル、メトブロムロン、メトラクロール、S-メトラクロール、メトスラム、メトクスロン、メトリブジン、メトス

10

20

30

40

50

ルフロン、メトスルフロンーメチル、モリネート、モノリニュロン、モノスルフロン、モノスルフロンーエステル、MT-128、即ち、6-クロロ-N-[(2E)-3-クロロプロパー-2-エン-1-イル]-5-メチル-N-フェニルピリダジン-3-アミン、MT-5950、即ち、N-[3-クロロ-4-(1-メチルエチル)フェニル]-2-メチルペンタンアミド、NGGC-011、ナプロパミド、NC-310、即ち、4-(2,4-ジクロロベンゾイル)-1-メチル-5-ベンジルオキシピラゾール、ネブロン、ニコスルフロン、ノナン酸（ペラルゴン酸）、ノルフルラゾン、オレイン酸（脂肪酸）、オルベンカルブ、オルソスルファミロン、オリザリン、オキサジアルギル、オキサジアゾン、オキサスルフロン、オキサジクロメホン、オキシフルオルフェン、パラコート、パラコート-ジクロリド、ペブレート、ペンジメタリン、ペノキススラム、ペンタクロロフェノール、ペントキサゾン、ペトキサミド、石油、フェンメジファミン、ピクロラム、ピコリナフェン、ピノキサデン、ピペロホス、プレチラクロール、プリミスルフロン、プリミスルフロンーメチル、プロジアミン、プリフルラリン、プロホキシジウム、プロメトン、プロメトリン、プロパクロール、プロパニル、プロパキザホップ、プロパジン、プロファミン、プロピソクロール、プロポキシカルバゾン、プロポキシカルバゾン-ナトリウム、プロピリスルフロン、プロピザミド、プロスルホカルブ、プロスルフロン、ピラクロニル、ピラフルフェン、ピラフルフェン-エチル、ピラスルホトール、ピラゾリネート（ピラゾレート）、ピラゾスルフロン、ピラゾスルフロン-エチル、ピラゾキシフェン、ピリバムベンズ（pyribambenz）、ピリバムベンズ-イソプロピル、ピリバムベンズ-プロピル、ピリベンゾキシム、ピリブチカルブ、ピリダホール、ピリデート、ピリフタリド、ピリミノバック、ピリミノバック-メチル、ピリミスルファン、ピリチオバック、ピリチオバック-ナトリウム、ピロキサスルホン、ピロキシスラム、キンクロラック、キンメラック、キノクラミン、キザロホップ、キザロホップ-エチル、キザロホップ-P、キザロホップ-P-エチル、キザロホップ-P-テフリル、リムスルフロン、サフルフェナシル、セトキシジウム、シデュロン、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、スルホメツロン-メチル、スルホセート（グリホセート-トリメシウム）、スルホスルフロン、SW-065、SYN-523、SYP-249、即ち、1-エトキシ-3-メチル-1-オキソブタ-3-エン-2-イル-5-[(2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ)-2-ニトロベンゾエート、SYP-300、即ち、1-[7-フルオロ-3-オキソ-4-(プロパー-2-イン-1-イル)-3,4-ジヒドロ-2H-1,4-ベンゾオキサジン-6-イル]-3-プロピル-2-チオキソイミダゾリジン-4,5-ジオン、TCA、TCA-ナトリウム、テブチウロン、テフリルトリオン、テンボトリオン、テブラロキシジウム、テルバシル、テルブカルブ、テルブメトン、テルブチラジン、テルブトリン、テニルクロール、チアゾピル、チエンカルバゾン、チエンカルバゾン-メチル、チフェンスルフロン、チフェンスルフロン-メチル、チオベンカルブ、トプラメゾン、トラルコキシジウム、トリアファモン、トリアラート、トリアスルフロン、トリアジファミン、トリベヌロン、トリベヌロン-メチル、トリクロピル、トリエタジン、トリフロキシスルフロン、トリフロキシスルフロン-ナトリウム、トリフルラリン、トリフルスルフロン、トリフルスルフロン-メチル、トリトスルフロン、バーナレート、ZJ-0862、即ち、3,4-ジクロロ-N-{2-[(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)オキシ]ベンジル}アニリン、及び、さらに、以下の化合物

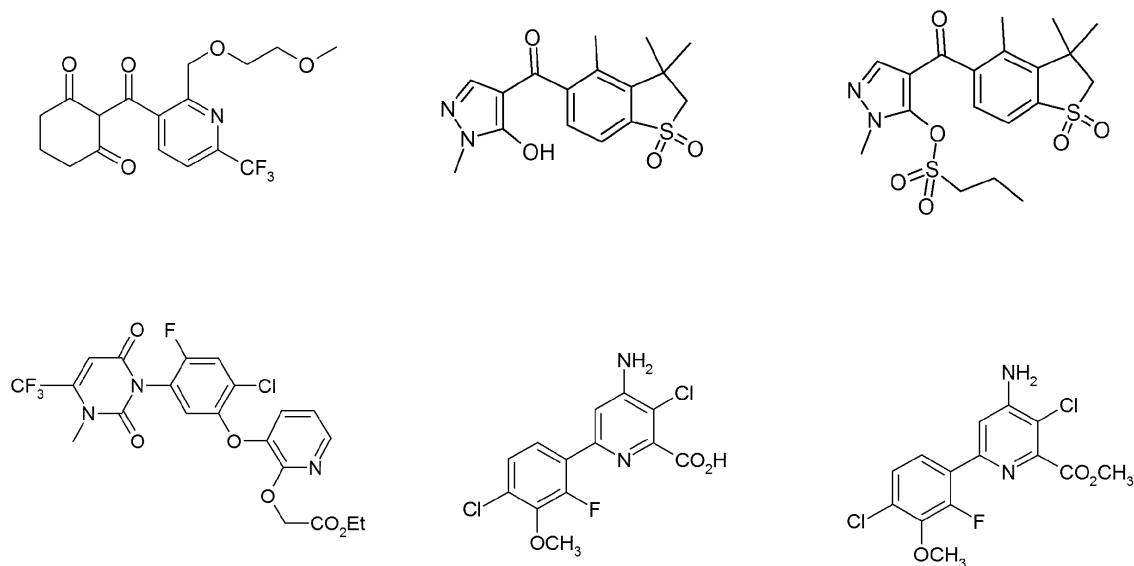
10

20

30

40

【化 8】



10

【0162】

可能な混合相手剤としての植物成長調節剤の例は、以下のものである：

アシベンゾラル、アシベンゾラルー S-メチル、アンシミドール、5-アミノレブリン酸、6-ベンジルアミノプリン、クロルメコートクロリド、クロプロップ、シクラニリド、3-(シクロプロパー1-エニル)プロピオン酸、ダミノジド、ダゾメット、ジケグラック、ジケグラック-ナトリウム、エテホン、フルメトラリン、フルレノール、フルレノール-ブチル、フルルプリミドール、ホルクロルフエニユロン、ジベレリン酸、イナベンフィド、インドール酢酸 (IAA)、4-インドール-3-イル酪酸、ジャスモン酸、ジャスモン酸エチル、マレイン酸ヒドラジド、メピコートクロリド、1-メチルシクロプロペン、2-(1-ナフチル)アセトアミド、1-ナフチル酢酸、2-ナフチルオキシ酢酸、ニトロフェノレート-ナトリウム (異性体混合物)、4-オキソ-4-[(2-フェニルエチル)アミノ]酪酸、パクロブトラゾール、N-フェニルフタルアミド、プロヘキサジオン、プロヘキサジオン-カルシウム、プロヒドロジャスモン、サリチル酸、ストリゴラクトン、テクナゼン、チジアズロン、トリアコンタノール、トリネキサパック、トリネキサパッカー-エチル、チトデフ (tsitodef)、ウニコナゾール、ウニコナゾール-P。

20

30

【0163】

特に興味深いのは、有用な植物の作物及び観賞植物の中の有害な植物を選択的に防除することである。本発明による一般式 (I) で表される化合物が多くの種類の作物において極めて良好な選択性から充分な選択性までを有していることが既に実証されているが、原則として、一部の作物において、及び、特に、選択性が劣る別の除草剤との混合物の場合にも、作物植物に対する薬害が生じ得る。これに関連して、一般式 (I) で表される化合物又は一般式 (I) で表される化合物と別の除草剤若しくは殺有害生物剤及び薬害軽減剤との組合せを含んでいる本発明による一般式 (I) で表される化合物の組合せは、特に興味深い。薬害軽減剤は、解毒効果を示す量で使用されるが、そのような薬害軽減剤は、例えば、経済上重要な作物〔例えば、穀類 (コムギ、オオムギ、ライムギ、トウモロコシ、イネ、アワ)、テンサイ、サトウキビ、ナタネ、ワタ及びダイズ、好ましくは、穀類〕において使用される、除草剤/殺有害生物剤の副次的な植物毒性効果を低減させる。以下の化合物の群は、例えば、化合物 (I) 単独又はさらなる殺有害生物剤との組み合わせられた化合物 (I) ための薬害軽減剤として、適している。

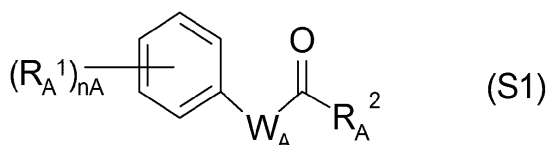
40

【0164】

そのような薬害軽減剤は、好ましくは、からなる群から選択される；：

(S1) 式 (S1)

【化 9】



【0165】

〔式中、記号及び添え字は、以下の意味を有する：

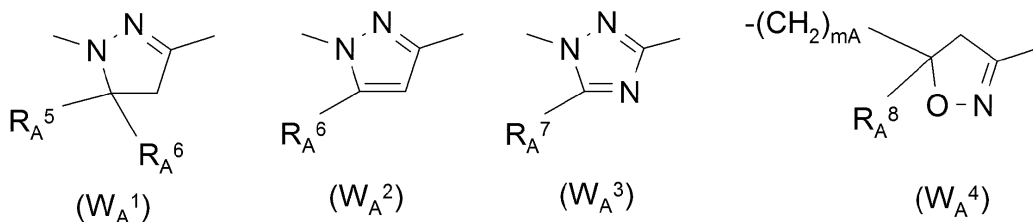
n_A は、0～5 の自然数、好ましくは、0～3 の自然数であり；

R_A^1 は、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ、ニトロ又は $(C_1 - C_4)$ - ハロアルキルであり；

10

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

【化 10】



20

【0166】

からなる群から選択されるラジカルであり；

m_A は、0 又は 1 であり；

R_A^2 は、 OR_A^3 、 SR_A^3 若しくは $NR_A^3 R_A^4$ であるか、又は、少なくとも 1 個の窒素原子と最大で 3 個までのヘテロ原子（好ましくは、O 及び S からなる群から選択されるヘテロ原子）を有する飽和又は不飽和の 3～7 員のヘテロ環（ここで、該ヘテロ環は、窒素原子を介して (S1) 内のカルボニル基に結合しており、そして、該ヘテロ環は、置換されていないか、又は、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ若しくは置換されていてもよいフェニルからなる群から選択されるラジカルで置換されている）であり、好ましくは、式 OR_A^3 、式 NHR_A^4 又は式 $N(CH_3)_2$ で表されるラジカルであり、特に、式 OR_A^3 で表されるラジカルであり；

30

R_A^3 は、水素であるか、又は、置換されていないか若しくは置換されている（好ましくは、合計で 1～18 個の炭素原子を有する）脂肪族ヒドロカルビルラジカルであり；

R_A^4 は、水素、 $(C_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - アルコキシであるか、又は、置換されているか若しくは置換されていないフェニルであり；

R_A^5 は、H、 $(C_1 - C_8)$ - アルキル、 $(C_1 - C_8)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_8)$ - アルキル、シアノ又は $COOR_A^9$ （ここで、 R_A^9 は、水素、 $(C_1 - C_8)$ - アルキル、 $(C_1 - C_8)$ - ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ - $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_6)$ - ヒドロキシアルキル、 $(C_3 - C_{12})$ - シクロアルキル又はトリ - $(C_1 - C_4)$ - アルキルシリルである）であり；

40

R_A^6 、 R_A^7 、 R_A^8 は、同一であるか又は異なっていて、そして、それぞれ、水素、 $(C_1 - C_8)$ - アルキル、 $(C_1 - C_8)$ - ハロアルキル、 $(C_3 - C_{12})$ - シクロアルキルであるか、又は、置換されているか若しくは置換されていないフェニルである

で表される化合物；

好ましくは：

50

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

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

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

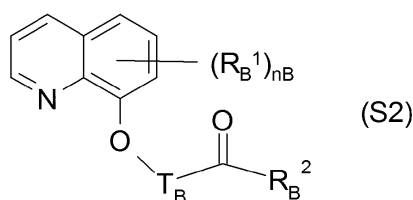
(d) トリアゾールカルボン酸のタイプの化合物 (S1d)、好ましくは、以下のような化合物：フェンクロラゾール (エチルエステル)、即ち、1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-トリクロロメチル-(1H)-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボン酸エチル (S1-7) 及び関連化合物 (これらは、EP-A-174562 及び EP-A-346620 に記載されている)；

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

【0167】

(S2) 式 (S2)

【化11】



【0168】

〔式中、記号及び添え字は、以下の意味を有する：

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

n_B は、0～5の自然数、好ましくは、0～3の自然数であり；

R_B^2 は、 OR_B^3 、 SR_B^3 若しくは $NR_B^3R_B^4$ であるか、又は、少なくとも1

10

20

30

40

50

個の窒素原子と最大で3個までのヘテロ原子（好ましくは、O及びSからなる群から選択されるヘテロ原子）を有する飽和又は不飽和の3～7員のヘテロ環（ここで、該ヘテロ環は、窒素原子を介して（S2）内のカルボニル基に結合しており、そして、該ヘテロ環は、置換されていないか、又は、（C₁－C₄）－アルキル、（C₁－C₄）－アルコキシ若しくは置換されていてもよいフェニルからなる群から選択されるラジカルで置換されている）であり、好ましくは、式OR_B³、式NHR_B⁴又は式N（CH₃）₂で表されるラジカルであり、特に、式OR_B³で表されるラジカルであり；

R_B³は、水素であるか、又は、置換されていないか若しくは置換されている（好ましくは、合計で1～18個の炭素原子を有する）脂肪族ヒドロカルビルラジカルであり；

R_B⁴は、水素、（C₁－C₆）－アルキル、（C₁－C₆）－アルコキシであるか、又は、置換されているか若しくは置換されていないフェニルであり；

T_Bは、（C₁－、又は、C₂）－アルカンジイル鎖（ここで、該アルカンジイル鎖は、置換されていないか、又は、1若しくは2の（C₁－C₄）－アルキルラジカルで置換されているか、又は、〔（C₁－C₃）－アルコキシ〕カルボニルで置換されている）である；

で表されるキノリン誘導体；

好ましくは：

（a） 8－キノリンオキシ酢酸のタイプの化合物（S2a）、好ましくは、（5－クロロ－8－キノリンオキシ）酢酸1－メチルヘキシル（「クロキントセット－メキシル」）

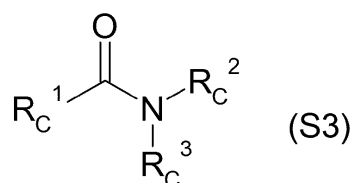
（S2-1）、（5－クロロ－8－キノリンオキシ）酢酸1，3－ジメチルブター1－イル（S2-2）、（5－クロロ－8－キノリンオキシ）酢酸4－アリルオキシブチル（S2-3）、（5－クロロ－8－キノリンオキシ）酢酸1－アリルオキシプロパー2－イル（S2-4）、（5－クロロ－8－キノリンオキシ）酢酸エチル（S2-5）、（5－クロロ－8－キノリンオキシ）酢酸メチル（S2-6）、（5－クロロ－8－キノリンオキシ）酢酸アリル（S2-7）、（5－クロロ－8－キノリンオキシ）酢酸2－（2－プロピリデンイミノオキシ）－1－エチル（S2-8）、（5－クロロ－8－キノリンオキシ）酢酸2－オキソプロパー1－イル（S2-9）及び関連化合物（これらは、EP-A-86750、EP-A-94349及びEP-A-191736又はEP-A-0492366に記載されている）、並びに、さらに、（5－クロロ－8－キノリンオキシ）酢酸（S2-10）、その水和物及び塩、例えば、そのリチウム塩、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩、アルミニウム塩、鉄塩、アンモニウム塩、第四級アンモニウム塩、スルホニウム塩又はホスホニウム塩（これらは、WO-A-2002/34048に記載されている）；

（b） （5－クロロ－8－キノリンオキシ）マロン酸のタイプの化合物（S2^b）、好ましくは、以下のような化合物：（5－クロロ－8－キノリンオキシ）マロン酸ジエチル、（5－クロロ－8－キノリンオキシ）マロン酸ジアリル、（5－クロロ－8－キノリンオキシ）マロン酸メチルエチル及び関連化合物（これらは、EP-A-0582198に記載されている）。

【0169】

（S3） 式（S3）

【化12】



【0170】

〔式中、記号及び添え字は、以下の意味を有する：

R_C¹は、（C₁－C₄）－アルキル、（C₁－C₄）－ハロアルキル、（C₂－C₄

) -アルケニル、(C₂-C₄)-ハロアルケニル、(C₃-C₇)-シクロアルキルであり、好ましくは、ジクロロメチルであり；

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

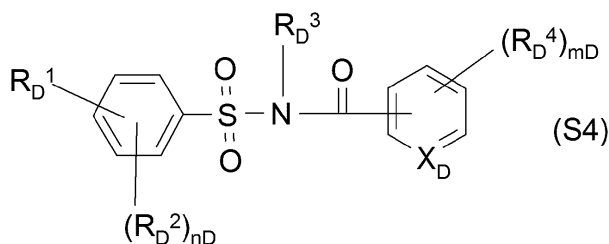
好ましくは：

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

【0171】

(S4) 式 (S4)

【化13】



【0172】

〔式中、記号及び添え字は、以下の意味を有する：

X_Dは、CH又はNであり；

R_D¹は、CO-NR_D⁵R_D⁶又はNHCO-R_D⁷であり；

R_D²は、ハロゲン、(C₁-C₄)-ハロアルキル、(C₁-C₄)-ハロアルコキシ、ニトロ、(C₁-C₄)-アルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)

10

20

30

40

50

ーアルキルスルホニル、(C₁－C₄)ーアルコシカルボニル又は(C₁－C₄)ーアルキルカルボニルであり；

R_D³は、水素、(C₁－C₄)ーアルキル、(C₂－C₄)ーアルケニル又は(C₂－C₄)ーアルキニルであり；

R_D⁴は、ハロゲン、ニトロ、(C₁－C₄)ーアルキル、(C₁－C₄)ーハロアルキル、(C₁－C₄)ーハロアルコシ、(C₃－C₆)ーシクロアルキル、フェニル、(C₁－C₄)ーアルコシ、シアノ、(C₁－C₄)ーアルキルチオ、(C₁－C₄)ーアルキルスルフィニル、(C₁－C₄)ーアルキルスルホニル、(C₁－C₄)ーアルコシカルボニル又は(C₁－C₄)ーアルキルカルボニルであり；

R_D⁵は、水素、(C₁－C₆)ーアルキル、(C₃－C₆)ーシクロアルキル、(C₂－C₆)ーアルケニル、(C₂－C₆)ーアルキニル、(C₅－C₆)ーシクロアルケニル、フェニル又は3～6員のヘテロ環（ここで、該ヘテロ環は、窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択されるv_D個のヘテロ原子を含んでいる）であり（ここで、後方に挙げられている7つのラジカルは、ハロゲン、(C₁－C₆)ーアルコシ、(C₁－C₆)ーハロアルコシ、(C₁－C₂)ーアルキルスルフィニル、(C₁－C₂)ーアルキルスルホニル、(C₃－C₆)ーシクロアルキル、(C₁－C₄)ーアルコシカルボニル、(C₁－C₄)ーアルキルカルボニル及びフェニルからなる群から選択される、また、環式ラジカルの場合には、さらに、(C₁－C₄)ーアルキル及び(C₁－C₄)ーハロアルキルからなる群からも選択される、v_Dの置換基で置換されている）；

R_D⁶は、水素、(C₁－C₆)ーアルキル、(C₂－C₆)ーアルケニル又は(C₂－C₆)ーアルキニルであり（ここで、後方に挙げられている3つのラジカルは、ハロゲン、ヒドロキシ、(C₁－C₄)ーアルキル、(C₁－C₄)ーアルコシ及び(C₁－C₄)ーアルキルチオからなる群から選択されるv_Dのラジカルで置換されている）；又は、

R_D⁵とR_D⁶は、それらを有している窒素原子と一緒に、ピロリジニルラジカル又はピペリジニルラジカルを形成しており；

R_D⁷は、水素、(C₁－C₄)ーアルキルアミノ、ジ－(C₁－C₄)ーアルキルアミノ、(C₁－C₆)ーアルキル又は(C₃－C₆)ーシクロアルキルであり（ここで、後方に挙げられている2つのラジカルは、ハロゲン、(C₁－C₄)ーアルコシ、(C₁－C₆)ーハロアルコシ及び(C₁－C₄)ーアルキルチオからなる群から選択される、また、環式ラジカルの場合には、さらに、(C₁－C₄)ーアルキル及び(C₁－C₄)ーハロアルキルからなる群からも選択される、v_Dの置換基で置換されている）；

n_Dは、0、1又は2であり；

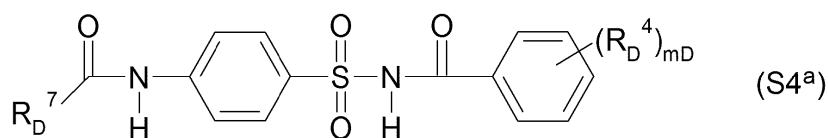
m_Dは、1又は2であり；

v_Dは、0、1、2又は3である]

で表されるNーアシルスルホンアミド類及びそれらの塩；

これらの中で、例えば、WO-A-97/45016から知られている、例えば、下記式(S4^a)

【化14】



【0173】

〔式中、

R_D⁷は、(C₁－C₆)ーアルキル又は(C₃－C₆)ーシクロアルキルであり（ここで、後方に挙げられている2つのラジカルは、ハロゲン、(C₁－C₄)ーアルコシ、(C₁－C₆)ーハロアルコシ及び(C₁－C₄)ーアルキルチオからなる群から選択される、また、環式ラジカルの場合には、さらに、(C₁－C₄)ーアルキル及び(C₁－C₄)ーハロアルキルからなる群からも選択される、v_Dの置換基で置換されている

);

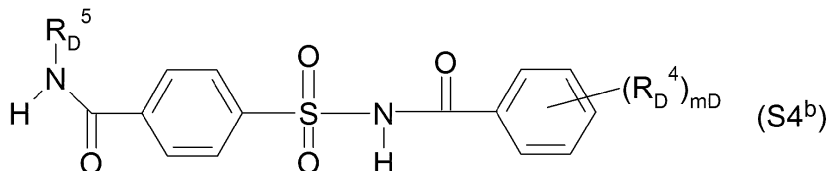
R_D^4 は、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ又は CF_3 であり;

mD は、1 又は 2 であり;

vD は、0、1、2 又は 3 である]

で表される N-アシルスルホンアミドのタイプの化合物が好ましく、及び、例えば、WO-A-99/16744 から知られている、例えば、下記式 (S4^b)

【化 15】



10

【0174】

で表されるアシルスルファモイルベンズアミド類、例えば、上記式において、

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

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

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

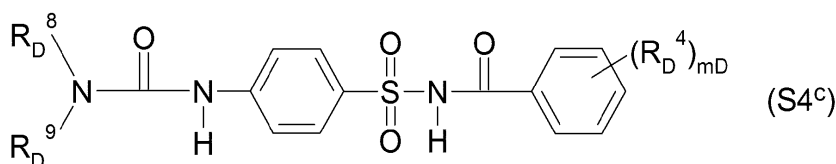
R_D^5 = イソプロピル、且つ、 $(R_D^4) = 5-Cl-2-OMe$ (S4-4); 及び

20

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

であるものなども好ましく、及び、例えば、EP-A-365484 から知られている、下記式 (S4^c)

【化 16】



30

【0175】

[式中、

R_D^8 及び R_D^9 は、それぞれ独立して、水素、 $(C_1 - C_8)$ - アルキル、 $(C_3 - C_8)$ - シクロアルキル、 $(C_3 - C_6)$ - アルケニル又は $(C_3 - C_6)$ - アルキニルであり;

R_D^4 は、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ - アルキル、 $(C_1 - C_4)$ - アルコキシ又は CF_3 であり、

mD は、1 又は 2 である]

で表される N-アシルスルファモイルフェニル尿素のタイプの化合物、例えば、

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

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

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

なども好ましい。

40

【0176】

(S5) ヒドロキシ芳香族類及び芳香族-脂肪族カルボン酸誘導体の類から選択される活性化合物 (S5)、例えば、3, 4, 5-トリアセトキシ安息香酸エチル、3, 5-

50

ジメトキシ-4-ヒドロキシ安息香酸、3,5-ジヒドロキシ安息香酸、4-ヒドロキシサリチル酸、4-フルオロサリチル酸、2-ヒドロキシケイ皮酸、2,4-ジクロロケイ皮酸（これらは、WO-A-2004/084631、WO-A-2005/015994、WO-A-2005/016001に記載されている）。

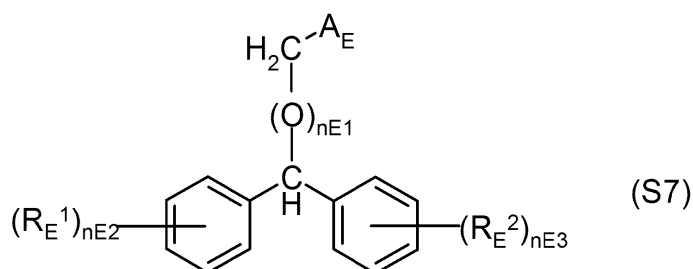
【0177】

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

10

【0178】

(S7) 式(S7)（これは、WO-A-1998/38856に記載されている）
【化17】



20

【0179】

〔式中、記号及び添え字は、以下の意味を有する：

R_E^1 、 R_E^2 は、それぞれ独立して、ハロゲン、 (C_1-C_4) -アルキル、 (C_1-C_4) -アルコキシ、 (C_1-C_4) -ハロアルキル、 (C_1-C_4) -アルキルアミノ、ジ- (C_1-C_4) -アルキルアミノ又はニトロであり；

A_E は、 $COOR_E^3$ 又は OSR_E^4 であり；

R_E^3 、 R_E^4 は、それぞれ独立して、水素、 (C_1-C_4) -アルキル、 (C_2-C_6) -アルケニル、 (C_2-C_4) -アルキニル、シアノアルキル、 (C_1-C_4) -ハロアルキル、フェニル、ニトロフェニル、ベンジル、ハロベンジル、ピリジニルアルキル及びアルキルアンモニウムであり；

30

n_{E1} は、0又は1であり；

n_{E2} 、 n_{E3} は、それぞれ独立して、0、1又は2である〕

で表される化合物；

好ましくは：

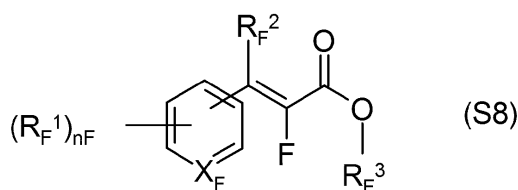
ジフェニルメトキシ酢酸、ジフェニルメトキシ酢酸エチル、ジフェニルメトキシ酢酸メチル (CAS Reg. No. : 41858-19-9) (S7-1)。

【0180】

40

(S8) 式(S8)（これは、WO-A-98/27049に記載されている）

【化18】



【0181】

〔式中、

50

X_F は、CH又はNであり；

n_F は、 $X_F = N$ である場合、0～4の整数であり；及び、

n_F は、 $X_F = CH$ である場合、0～5の整数であり；

R_F^1 は、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、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルコキシ、ニトロ、 $(C_1 - C_4)$ -アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ -アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシカルボニル、置換されていてもよいフェニル又は置換されていてもよいフェノキシであり；

R_F^2 は、水素又は $(C_1 - C_4)$ -アルキルであり；

R_F^3 は、水素、 $(C_1 - C_8)$ -アルキル、 $(C_2 - C_4)$ -アルケニル、 $(C_2 - C_4)$ -アルキニル又はアリール（ここで、上記炭素含有ラジカルは、それぞれ、置換されていないか、又は、ハロゲン及びアルコキシからなる群から選択される1以上の（好ましくは、最大で3までの）同一であるか若しくは異なっているラジカルで置換されている）である；

で表される化合物又はその塩；

好ましくは、上記式中、

X_F が、CHであり；

n_F が、0～2の整数であり；

R_F^1 が、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $(C_1 - C_4)$ -ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ又は $(C_1 - C_4)$ -ハロアルコキシであり；

R_F^2 が、水素又は $(C_1 - C_4)$ -アルキルであり；

R_F^3 が、水素、 $(C_1 - C_8)$ -アルキル、 $(C_2 - C_4)$ -アルケニル、 $(C_2 - C_4)$ -アルキニル又はアリール（ここで、上記炭素含有ラジカルは、それぞれ、置換されていないか、又は、ハロゲン及びアルコキシからなる群から選択される1以上の（好ましくは、最大で3までの）同一であるか若しくは異なっているラジカルで置換されている）である；

化合物又はその塩。

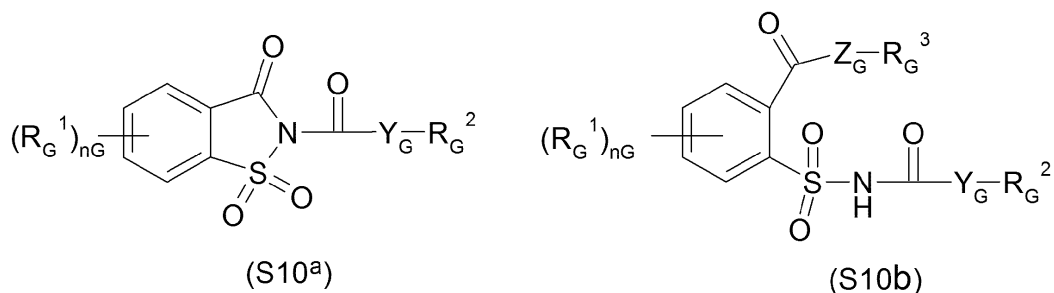
【0182】

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

【0183】

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

【化19】



【0184】

〔式中、

R_G^1 は、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ -アルキル、メトキシ、ニトロ、シアノ、 CF_3 又は OCF_3 であり；

Y_G 、 Z_G は、それぞれ互いに独立して、O又はSであり；

n G は、0～4の整数であり；

R_G^2 は、 $(C_1 - C_{16})$ －アルキル、 $(C_2 - C_6)$ －アルケニル、 $(C_3 - C_6)$ －シクロアルキル、アリール、ベンジル又はハロベンジルであり；

R_G^3 は、水素又は $(C_1 - C_6)$ －アルキルである〕
で表される化合物。

【0185】

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

「オキサベトリニル」 $((Z)-1, 3-ジオキソラン-2-イルメトキシイミノ(フェニル)アセトニトリル)$ (S11-1) (これは、メトラクロールによる損傷に対する

10

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

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

【0186】

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

20

【0187】

(S13) 以下の群から選択される1種類以上の化合物 (S13)：

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

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

30

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

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

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

40

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

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

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

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

50

【0188】

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

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

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

「クミルロン」=「JC-940」(3-(2-クロロフェニルメチル)-1-(1-メチル-1-フェニルエチル)尿素；JP-A-60087254を参照されたい)(これは、ある種の除草剤による損傷に対するイネ用の薬害軽減剤として知られている)；

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

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

【0189】

(S15) 主に除草剤として使用されるが作物植物に対する薬害軽減効果も有している活性化合物、例えば、

(2, 4-ジクロロフェノキシ)酢酸(2, 4-D)；

(4-クロロフェノキシ)酢酸；

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

4-(2, 4-ジクロロフェノキシ)酪酸(2, 4-DB)；

(4-クロロ-オ-トリルオキシ)酢酸(MCPA)；

4-(4-クロロ-オ-トリルオキシ)酪酸；

4-(4-クロロフェノキシ)酪酸；

3, 6-ジクロロ-2-メトキシ安息香酸(ジカンバ)；

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

【0190】

一部の薬害軽減剤は、除草剤としても既に知られており、従って、有害な植物に対する除草作用に加えて、作物植物を保護することによっても作用する。

【0191】

除草剤(混合物)と薬害軽減剤の重量比は、一般に、除草剤の施用量と当該薬害軽減剤の効力に依存し、そして、広い範囲内で、例えば、200:1~1:200の範囲内で、好ましくは、100:1~1:100の範囲内で、特に、20:1~1:20の範囲内で、さまざまであり得る。式(I)で表される化合物又はその混合物と同様に、上記薬害軽減剤も、さらなる除草剤/殺有害生物剤と一緒に製剤することが可能であり、そして、除草剤を含んでいる完成された製剤又はタンクミックスとして供給及び使用することができる。

【0192】

施用に際しては、商業用の標準的な形態で存在している製剤は、適切な場合には、慣習的な方法で希釈し、例えば、水和剤、乳剤、分散製剤(dispersion)及び顆粒水和剤の場合には、水を用いて希釈する。粉剤タイプの製剤、土壌施用用粒剤又はばらまき用粒剤及び散布可能溶液剤(sprayable solution)は、通常、施用の前に別の不活性物質でさらに希釈することはない。

【0193】

一般式(I)で表される化合物の必要とされる施用量は、外部条件(例えば、とりわけ

10

20

30

40

50

、温度、湿度及び使用する除草剤の種類など）に応じて変わる。それは、広い範囲内でさまざまであることができ、例えば、0.001～10.0 kg/ha又はそれ以上の活性物質であることができるが、好ましくは、0.005～5 kg/haである。

【0194】

下記実施例によって、本発明についてさらに詳細に例証する。しかしながら、これらの実施例は、決して、本発明を限定するものではない。

【0195】

A. 合成実施例

5-[(6-エチル-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル) アミノ] ピリミジン-2-カルボニトリル (Ex. : 64) :

1. 5 mL の N, N-ジメチルアセトアミドの中の 0.20 g (1.09 mmol) の 5-ブロモ-2-シアノピリミジン (ABCR 245244)、0.325 g (1.52 mmol) の 6-エチル-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-アミニウムクロリド及び 0.35 g (3.3 mmol) の トリエチルアミンを、マイクロ波オーブン内の密閉されたキュベットの中で 200℃ で 120 分間加熱する (Biotage Initiator, <http://www.biotage.com/DynPage.aspx?id=22001>)。このようにして得られた粗製混合物をシリカゲルに注ぎ、移動相ヘプタン/酢酸エチルを使用するカラムクロマトグラフィーで精製することにより、0.03 g の 5-[(6-エチル-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル) アミノ] ピリミジン-2-カルボニトリル (蠟様) (純度 80% で収率 8%) が得られる。

【0196】

N- (3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル) -2- (メチルスルホニル) ピリミジン-5-アミン (Ex. : 92) :

1. 5 mL の N, N-ジメチルアセトアミドの中の 0.25 g (1.29 mmol) の 5-クロロ-2- (メチルスルホニル) ピリミジン、0.27 g (1.42 mmol) の 3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-アミン塩酸塩及び 0.42 g (3.89 mmol) の トリエチルアミンを、マイクロ波オーブン内の密閉されたキュベットの中で 180℃ で 125 分間加熱する (Biotage Initiator, <http://www.biotage.com/DynPage.aspx?id=22001>)。このようにして得られた粗製混合物をシリカゲルに注ぎ、移動相ヘプタン/酢酸エチルを使用するカラムクロマトグラフィーで精製することにより、最初に、0.08 g の 5-クロロ-2- { [(1R,2S) -2,6-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル] アミノ } ピリミジン-4-カルボキサミド (蠟様) が得られ、次いで、0.09 g の N- (3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル) -2- (メチルスルホニル) ピリミジン-5-アミン (蠟様、純度 85% で収率 19%) が得られる。

【0197】

5- { [(1R,2S) -2,6-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル] アミノ } -2- (メチルスルホニル) ピリミジン-4-カルボキサミド (Ex. : 93) :

攪拌しながら、40.8 g (25 mL、0.34 mol) の塩化チオニルと 0.47 g (0.5 mL、6.5 mmol) の N, N-ジメチルホルムアミドに 15 g の 5-クロロ-2- (メチルスルファニル) ピリミジン-4-カルボン酸を少量ずつ添加し、次いで、ガスの著しい発生が目立たなくなるまで、その反応混合物を加熱還流した。その混合物を取って少量の塩化メチレンの中に入れる。濃縮して、15 g の 5-クロロ-2- (メチルスルファニル) ピリミジン-4-カルボニルクロリドを得た。これは、それ以上精製することなく次の段階で使用した。

【0198】

15 g (67.2 mmol) の 5-クロロ-2- (メチルスルファニル) ピリミジン-4-カルボニルクロリドを 35 mL のジオキサンに溶解させ、5℃まで冷却する。その冷

却された溶液に、メタノール中の57.3 g (0.4 mol) の7Nアンモニア (約12%強度の溶液) をゆっくりと滴下して加える。その添加中は、反応温度を15℃未満に維持した。滴下による添加が完了した後、その反応混合物を室温まで昇温させ、約15時間攪拌した。次いで、その混合物を水に添加し、沈澱した5-クロロ-2-(メチルスルファニル)ピリミジン-4-カルボキサミドを単離した (7.7 g、純度95%で収率53%)。

【0199】

30 mLの水と30 mLの酢酸と30 mLのメタノールの混合物に7.7 g (37.8 mmol) の5-クロロ-2-(メチルスルファニル)ピリミジン-4-カルボキサミド及び37.2 g (60.4 mmol) のペルオキソ-硫酸カリウムを懸濁させ、その混合物を約3時間攪拌する。次いで、その混合物を取って約100 mLの水の中に入れ、酢酸エチルで抽出する。その酢酸エチル抽出物を脱水し、濃縮して、1.5 gの5-クロロ-2-(メチルスルホニル)ピリミジン-4-カルボキサミドを得た (融点205℃、純度95%で収率17%)。その母液から、追加の5-クロロ-2-(メチルスルホニル)ピリミジン-4-カルボキサミドを単離することが可能であった。

【0200】

1.5 mLのN, N-ジメチルアセトアミドの中の0.30 g (1.27 mmol) の5-クロロ-2-(メチルスルホニル)ピリミジン-4-カルボキサミド、0.25 g (1.53 mmol) の(1R, 2S)-2, 6-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-アミン及び0.28 g (2.54 mmol) のトリエチルアミンを、マイクロ波オープン内の密閉されたキュベットの中で120℃で45分間加熱する (Biotage Initiator, <http://www.biotage.com/DynPage.aspx?id=22001>)。このようにして得られた粗製混合物をシリカゲルに注ぎ、移動相ヘプタン/酢酸エチルを使用するカラムクロマトグラフィーで精製する。濃縮することにより、最初に、0.07 gの5-クロロ-2-{[(1R, 2S)-2, 6-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル]アミノ}ピリミジン-4-カルボキサミド (蠟様) が得られ、次いで、0.252 gの5-{[(1R, 2S)-2, 6-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル]アミノ}-2-(メチルスルホニル)ピリミジン-4-カルボキサミド (純度95%で収率52%) が得られる。

【0201】

N-[(1R)-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル]-2-(トリフルオロメチル)ピリミジン-5-アミン (Ex.: 115):

1.5 mLの1-メチル-2-ピロリドンの中の0.20 g (1.20 mmol) の5-フルオロ-2-(トリフルオロメチル)ピリミジン、0.225 g (1.69 mmol) の(1R)-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-アミン及び0.50 g (2.41 mmol) のジシクロヘキシルメチルアミンを、マイクロ波オープン内の密閉されたキュベットの中で180℃で120分間加熱する (Biotage Initiator, <http://www.biotage.com/DynPage.aspx?id=22001>)。このようにして得られた粗製混合物をシリカゲルに注ぎ、移動相ヘプタン/酢酸エチルを使用するカラムクロマトグラフィーで精製する。濃縮することにより、0.34 gのN-[(1R)-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル]-2-(トリフルオロメチル)ピリミジン-5-アミン (融点123.7℃、純度95%で収率96%) が得られる。

【0202】

2-(メチルスルホニル)-N-[(1R)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル]ピリミジン-5-アミン (Ex.: 273):

1.5 mLのN-メチルピロリドンの中の0.20 g (0.84 mmol) の5-クロロ-2-(メチルスルホニル)ピリミジン-4-カルボン酸、0.15 g (1.01 mmol) の(1R)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-アミン及び0.33

10

20

30

40

50

g (1.69 mmol) のジシクロヘキシルメチルアミンを、マイクロ波オーブン内の密閉されたキューベットの中で150℃で30分間加熱する (Biotage Initiator, <http://www.biotage.com/DynPage.aspx?id=22001>)。このようにして得られた粗製混合物をシリカゲルに注ぎ、移動相ヘプタン/酢酸エチルを使用するカラムクロマトグラフィーで精製する。濃縮することにより、最初に、0.024 g の5-クロロ-N-[(1R)-1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル]ピリミジン-2-アミン (固体) が得られ、次いで、0.08 g の2-(メチルスルホニル)-N-[(1R)-1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル]ピリミジン-5-アミン (蠟様、純度95%で収率31%) が得られる。

【表 3】

選択された合成実施例の物理化学的特徴付け：

化合物	記 述
62	蠟様; logp (HCOOH): 4.06; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ (ppm)): 2.10-2.35 (m, 2H, 2H of CH ₂); 2.15 (s, 3H, CH ₃); 2.20 (s, 3H, CH ₃); 4.15-4.35 (m, 2H, 2H of CH ₂ O); 5.05 (q, 1H, CH); 5.80 (br, 1H, NH); 6.90 (s 及び s, 2H, Ar-H); 8.15 (br, 2H, Pyr-H);
64	蠟様; logp (HCOOH): 2.80; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ (ppm)): 1.20 (t, 3H, CH ₃); 2.10 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.30 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.55 (t, 2H, CH ₂); 4.15 (m, 1H, 1H of CH ₂ O); 4.30 (m, 1H, 1H of CH ₂ O); 5.7 (br, 1H, CH); 6.80-7.10 (m, 3H, Ar-H); 8.20 (s, 2H, Pyr-H);
65	蠟様; logp (HCOOH): 2.54; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ (ppm)): 1.20 (t, 3H, CH ₃); 2.10 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.25 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.55 (t, 2H, CH ₂); 3.10 (s, 3H, SO ₂ CH ₃); 4.15 (m, 1H, 1H of CH ₂ O); 4.30 (m, 1H, 1H of CH ₂ O); ; 5.25 (q, 1H, CH); 6.30 (br, 1H, NH); 6.80 (d, 1H, Ar-H); 7.05 (s, 1H, Ar-H); 7.10 (d, 1H, Ar-H); 8.55 及び 8.80 (s, 2H, Pyr-H);
66	蠟様; logp (HCOOH): 2.54; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ (ppm)): 1.15 (t, 3H, CH ₃); 2.10 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.25 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.55 (t, 2H, CH ₂); 3.25 (s, 3H, SO ₂ CH ₃); 4.15 (m, 1H, 1H of CH ₂ O); 4.25 (m, 1H, 1H of CH ₂ O); ; 5.25 (q, 1H, CH); 6.40 (br, 1H, NH); 6.80 (d, 1H, Ar-H); 7.00 (s, 1H, Ar-H); 7.10 (d, 1H, Ar-H); 8.80 及び 8.90 (s, 2H, Pyr-H);
70	蠟様; logp (HCOOH): 3.41; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ (ppm)): 1.15 (t, 3H, CH ₃); 2.05 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.20 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.55 (t, 2H, CH ₂); 4.15 (m, 1H, 1H of CH ₂ O); 4.25 (m, 1H, 1H of CH ₂ O); ; 4.50 (br, 1H, NH); 4.70 (q, 1H, CH); 6.80 (d, 1H, Ar-H); 7.05 (s, 1H, Ar-H); 7.10 (d, 1H, Ar-H); 8.25 (s, 2H, Pyr-H);
76	蠟様; logp (HCOOH): 3.17; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ (ppm)): 1.25 (d, 3H, CH ₃); 2.30 (s, 3H, CH ₃); 2.35 (jm, 1H, 1H of CH ₂); 2.55 (m, 1H, 1H of CH ₂); 3.15 (q, 1H, 1H of CHCH ₃); 4.50 (br, 1H, NH); 4.55 (q, 1H, CH); 7.00 (s, 1H, Ar-H); 7.10 (d, 1H, Ar-H); 7.15 (d, 1H, Ar-H); 8.20 (s, 2H, Pyr-H);
83	固体; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ (ppm)): 1.85 (m, 2H, 2H of CH ₂); 2.00 (m, 2H, 2H of CH ₂); 2.80 (m, 2H, 2H of CH ₂); 4.50 (d, 1H, NH); 4.70 (q, 1H, CH); 7.15 – 7.25 (m, 4H, Ar-H); 8.15 (s, 2H, Pyr-H);
87	蠟様; logp (HCOOH): 1.86; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ (ppm)): 1.85 (m, 2H, 2H of CH ₂); 2.00 (m, 2H, 2H of CH ₂); 2.80 (m, 2H, 2H of CH ₂); ; 3.50 (s, 3H, SO ₂ CH ₃); 5.40 (br, 1H, CH); 5.8 (br, 1H, NH); 6.9 (br, 1H, NH ₂); 7.15 – 7.25 (m, 4H, Ar-H); 8.90 及び 9.00 (2s, 2H, Pyr-H);
92	蠟様; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ (ppm)): 2.10 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.25 (m, 1H, 1H of CH ₂); 3.05 (s, 3H, SO ₂ CH ₃); 4.20 (m, 1H, 1H of CH ₂ O); 4.30 (m, 1H, 1H of CH ₂ O); ; 5.35 (q, 1H, CH); 6.30 (br, 1H, NH); 6.90 (m, 2H, Ar-H); 7.25 (m, 2H, Ar-H); 8.55 及び 8.80 (s, 2H, Pyr-H);

10

20

30

40

化 合 物	記 述
93	蠟様; logp (HCOOH): 2.21; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ (ppm)): 1.25 (d, 3H, CH ₃); 2.30 (s, 3H, CH ₃); 2.35 (jm, 1H, 1H of CH ₂); 2.55 (m, 1H, 1H of CH ₂); 3.10 (q, 1H, 1H of CHCH ₃); 3.50 (s, 3H, SO ₂ CH ₃); 5.20 及び 5.40 (いずれの場合にも t, 1H, CH); 5.90 及び 6.20 (いずれの場合にも d, 1H, NH); 6.85 (br, 2H, NH ₂); 7.00-7.15 (m, 3H, Ar-H); 8.90 及び 9.00 (いずれの場合にも s, 1H, Pyr-H);
108	固体; logp (HCOOH): 3.29; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ (ppm)): 1.25 (d, 3H, CH ₃); 2.35 (s, 3H, CH ₃); 2.35 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.60 (m, 1H, 1H of CH ₂); 3.10 (q, 1H, 1H of CHCH ₃); 3.30 (s, 3H, SO ₂ CH ₃); 5.20 (m, 1H, CH); 6.05 (br, 1H, NH); 6.95 -7.15 (m, 3H, Ar-H); 8.85 及び 9.00 (いずれの場合にも s, 1H, Pyr-H);
109	固体; logp (HCOOH): 2.97; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ (ppm)): 1.90 (m, 3H, 1H of CH ₂ , 2H of CH ₂); 2.15 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.85 (m, 2H, 2H of CH ₂); 3.30 (s, 3H, SO ₂ CH ₃); 5.35 (m, 1H, CH); 6.20 (br, 1H, NH); 7.10 -7.25 (m, 4H, Ar-H); 8.80 及び 9.00 (いずれの場合にも s, 1H, Pyr-H);
111	固体; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ (ppm)): 1.95 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.30 (s, 3H, CH ₃); 2.65 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.95 (m, 1H, 1H of CH ₂); 3.05 (m, 1H, 1H of CH ₂); 4.40 (d, 1H, NH); 5.05 (q, 1H, CH); 7.10 -7.2 (m, 3H, Ar-H); 8.25 (s, 2H, Pyr-H);
115	固体; Smp.: 123 – 124 °C; logp (HCOOH): 3.05; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ (ppm)): 1.95 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.65 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.90 (m, 1H, 1H of CH ₂); 3.00 (m, 1H, 1H of CH ₂); 4.40 (d, 1H, NH); 5.05 (q, 1H, CH); 7.10 -7.20 (m, 4H, Ar-H); 8.20 (s, 2H, Pyr-H);
116	固体; Smp.: 83 – 84 °C; logp (HCOOH): 3.79; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ (ppm)): 1.25 (d, 3H, CH ₃); 2.30 (s, 3H, CH ₃); 2.35 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.60 (m, 1H, 1H of CH ₂); 3.10 (q, 1H, 1H of CHCH ₃); 4.35 (d, 1H, NH); 4.55 (q, 1H, CH); 7.05 (s, 1H, Ar-H); 7.15 (dd, 2H, Ar-H); 8.25 (s, 2H, Pyr-H);
117	固体; Smp.: 152 - 153 °C; logp (HCOOH): 3.45; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ (ppm)): 1.85 (m, 2H, 2H of CH ₂); 2.05 (m, 2H, 2H of CH ₂); 2.85 (m, 2H, 2H of CH ₂); 4.40 (d, 1H, NH); 4.70 (q, 1H, CH); 7.10 – 7.30 (m, 4H, Ar-H); 8.20 (s, 2H, Pyr-H);
131	固体; logp (HCOOH): 2.13; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ (ppm)): 1.95 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.70 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.90 (m, 1H, 1H of CH ₂); 3.05 (m, 1H, 1H of CH ₂); 3.10 (s, 3H, SO ₂ CH ₃); 5.65 (q, 1H, CH); 6.30 (d, 1H, NH); 7.15 -7.30 (m, 4H, Ar-H); 8.50 及び 8.80 (いずれの場合にも s, 1H, Pyr-H);
134	固体; Smp.: 182 - 183 °C; logp (HCOOH): 2.83; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ (ppm)): 1.25 (d, 3H, CH ₃); 2.30 (s, 3H, CH ₃); 2.35 (m, 1H, 1H of CH ₂); 2.50 (m, 1H, 1H of CH ₂); 3.05 (q, 1H, 1H of CHCH ₃); 3.10 (s, 3H, SO ₂ CH ₃); 5.35 (q, 1H, CH); 5.90 (d, 1H, NH); 7.00 (s, 1H, Ar-H); 7.10 (dd, 2H, Ar-H); 8.65 及び 8.80 (いずれの場合にも s, 1H, Pyr-H);

10

20

30

40

【 0 2 0 3 】

B. 製剤実施例

(a) 散粉性製品 (dusting product) は、10重量部の式 (I) で表される化合物及び／又はその塩と90重量部の不活性物質としてのタルクを混合させ、並びに、その混合物をハンマーミルの中で粉砕することによって得られる。

【 0 2 0 4 】

(b) 水に容易に分散する水和剤は、25重量部の式 (I) で表される化合物及び／

50

又はその塩と64重量部の不活性物質としてのカオリン含有石英と10重量部のリグノスルホン酸カリウムと1重量部の湿潤剤及び分散剤としてのオレオイルメチルタウリンナトリウム(sodium oleoylmethyltaurate)を混合させ、並びに、その混合物をピンディスクミル(pinned-disk mill)の中で摩砕することによって得られる。

【0205】

(c) 水に容易に分散する分散製剤(dispersion concentrate)は、20重量部の式(I)で表される化合物及び／又はその塩を6重量部のアルキルフェノールポリグリコールエーテル((登録商標)Triton X 207)と3重量部のイソトリデカノールポリグリコールエーテル(8EO)と71重量部のパラフィン系

10

【0206】

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

【0207】

(e) 顆粒水和剤は、
75重量部の式(I)で表される化合物及び／又はその塩、
10重量部のリグノスルホン酸カルシウム、
5重量部のラウリル硫酸ナトリウム、
3重量部のポリビニルアルコール、及び、
7重量部のカオリン
を混合させ、その混合物をピンディスクミルの中で摩砕し、並びに、得られた粉末を流動床の中で造粒液(granulating liquid)としての水を噴霧することにより造粒することによって得られる。

20

【0208】

(f) 顆粒水和剤は、さらにまた、コロイドミルの中で、
25重量部の式(I)で表される化合物及び／又はその塩、
5重量部の2, 2'-ジナフチルメタン-6, 6'-ジスルホン酸ナトリウム、
2重量部のオレオイルメチルタウリンナトリウム(sodium oleoylmethyltaurate)、
1重量部のポリビニルアルコール、
17重量部の炭酸カルシウム、及び、
50重量部の水
を均質化及び前粉碎し、次いで、その混合物をビーズミルの中で摩砕し、並びに、得られた懸濁液を噴霧槽の中で単一相ノズル(one-phase nozzle)を用いて噴霧及び乾燥させることによって得られる。

30

【0209】

C. 生物学的実施例

40

試験に関する記述

1. 発生前除草効果及び作物植物適合性

木質繊維製ポット内の砂壤土に单子葉及び双子葉の雑草植物と作物植物の種子を配置し、土壌で被覆する。次いで、その被覆した土壌の表面に、水和剤(WP)の形態に又は乳剤(EC)として製剤された本発明の化合物を、0.2%の湿潤剤が添加された600~800L/ha(変換)の散布水量の水性懸濁液又は水性エマルジョンとして施用する。

【0210】

処理後、ポットを温室内に置き、その被験植物にとって良好な成育条件下に維持する。3週間の試験期間の後、無処理対照と比較することにより、該被験植物に対するダメージを視覚的に評価する(除草活性(%)):100%の効果=植物の枯死、0%の効果=対照

50

植物と同様)。

【0211】

下記表において、以下の略号が使用されている：

【表4】

ABUTH：	イチビ (<i>Abutilon theophrasti</i>)
ALOMY：	ノスズメノテッポウ (<i>Alopecurus myosuroides</i>)
AMARE：	アオゲイトウ (<i>Amaranthus retroflexus</i>)
ECHCG：	イヌビエ (<i>Echinochloa crus-galli</i>)
LOLMU：	ネズミムギ (<i>Lolium multiflorum</i>)
MATIN：	イヌカミツレ (<i>Matricaria inodora</i>)
POLCO：	ソバカズラ (<i>Polygonum convolvulus</i>)
SETVI：	エノコログサ (<i>Setaria viridis</i>)
STEME：	ハコベ (<i>Stellaria media</i>)
VERPE：	オオイヌノフグリ (<i>Veronica persica</i>)
VIOTR：	サンシキスミレ (<i>Viola tricolor</i>)

10

20

【0212】

表1：

【表5】

Ex No.	薬量	単位	ALOMY	ECHCG	LOLMU	SETVI	ABUTH	AMARE	MATIN	POLCO	STEME	VERPE	VIOTR
65	1280	g/ha	90	100	90	100	100	100	100	100	100	100	100
66	1280	g/ha						100	90	90	100	100	100
68	1280	g/ha	100	100	90	100	100	100	100	100	100	100	100
93	1280	g/ha	90	100	90	90		100	100	100	100	100	100
131	1280	g/ha		100		90			100	100	100	100	
134	1280	g/ha	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
139	1280	g/ha	90		100			100	100		100	100	100

30

【0213】

上記結果によって示されているように、本発明による化合物は、広範囲のイネ科雑草及び広葉雑草に対して優れた発生前除草活性を有している。表1の化合物は、例えば、1ヘクタール当たり1.28kg以下の活性物質の施用量で発生前方法によって施用された場合、例えば、カラスムギ (*Avena fatua*)、ハコベ (*Stellaria media*)、イヌビエ (*Echinochloa crus-galli*)、ネズミムギ (*Lolium multiflorum*)、エノコログサ (*Setaria viridis*)、イチビ (*Abutilon theophrasti*)、アオゲイトウ (*Amaranthus retroflexus*) 及びノスズメノテッポウ (*Alopecurus myosuroides*) などの有害な植物に対して極めて優れた除草活性を示す。従って、本発明による化合物は、望ましくない植物の成長を発生前方法によって防除するのに適している。

40

【0214】

2. 発生效后除草効果及び作物植物適合性

木質繊維製ポット内の砂壤土に単子葉及び双子葉の雑草植物及び作物植物の種子を配置し、土壌で被覆し、温室内で良好な成育条件下で栽培する。播種後2～3週間経過した後

50

、被験植物を1葉期で処理する。水和剤（WP）の形態に又は乳剤（EC）として製剤された本発明の化合物を、0.2%の湿潤剤が添加された600～800L/ha（変換）の散布水量の水懸濁液又は水性エマルジョンとして当該植物の緑色の部分に噴霧する。その被験植物を温室内の最適な生育条件下に約3週間維持した後、無処理対照と比較して、該調製物の活性を視覚的に評価する（除草活性（%）：100%の効果＝植物の枯死、0%の効果＝対照植物と同様）。

【0215】

表2：

【表6】

Ex. No.	薬量	単位	ECHCG	ABUTH	AMARE	POLCO	STEME	VERPE	VIOTR
65	1280	g/ha	100	90		80	90		
68	1280	g/ha	90	90		80			80
93	1280	g/ha		80	80				
131	1280	g/ha			80	80		80	
134	1280	g/ha	90	90	80	90	100	90	90

【0216】

上記結果によって示されているように、本発明による化合物は、広範囲のイネ科雑草及び広葉雑草に対して優れた発生後除草効力を有している。表2の化合物は、例えば、1ヘクタール当たり1.28kg以下の活性物質の施用量で発生後方法によって施用された場合、例えば、カラスムギ（*Avena fatua*）、ハコベ（*Stellaria media*）、イヌビエ（*Echinochloa crus-galli*）、ネズミムギ（*Lolium multiflorum*）、エノコログサ（*Setaria viridis*）、イチビ（*Abutilon theophrasti*）、アオゲイトウ（*Amaranthus retroflexus*）及びノスズメノテッポウ（*Alopecurus myosuroides*）などの有害な植物に対して極めて優れた除草活性を示す。従って、本発明による化合物は、望ましくない植物の成長を発生後方法によって防除するのに適している。

フロントページの続き

- (74)代理人 100129713
弁理士 重森 一輝
- (74)代理人 100137213
弁理士 安藤 健司
- (74)代理人 100146318
弁理士 岩瀬 吉和
- (74)代理人 230105223
弁護士 城山 康文
- (72)発明者 ミン, クレーメンス
ドイツ国、6 5 7 9 5・ハッターズハイム、ロツサートシュトラッセ・6 1
- (72)発明者 ホフマン, ミヒヤエル・ゲルハルト
ドイツ国、6 5 4 3 9・フレーアスハイム、ヤーンシュトラッセ・6 アー
- (72)発明者 ガッツヴァイラー, エルマー
ドイツ国、6 1 2 3 1・バート・ナウハイム、アム・ナウハイマー・バツハ・2 2
- (72)発明者 ハインマン, イネス
ドイツ国、6 5 7 1 9・ホフハイム、ユビールシュトラッセ・1 3
- (72)発明者 ホイザー・ハーン, イゾルデ
ドイツ国、5 1 3 7 5・レーバークーゼン、ドューンフェルダー・シュトラッセ・2 2
- (72)発明者 ロジンガー, クリストファー
ドイツ国、6 5 7 1 9・ホフハイム・アム・タウヌス、アム・ホツホフェルド・3 3

審査官 伊藤 佑一

- (56)参考文献 独国特許出願公開第1 0 2 0 0 5 0 1 8 0 2 5 (DE, A1)
米国特許出願公開第2 0 0 7 / 0 0 1 5 7 6 1 (US, A1)
国際公開第2 0 1 0 / 0 7 6 0 0 9 (WO, A1)
国際公開第2 0 1 0 / 0 7 6 0 1 0 (WO, A1)
特表2 0 1 1 - 5 0 7 8 1 9 (JP, A)

- (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
C 0 7 D
A 0 1 N
A 0 1 P
CAplus/REGISTRY (STN)