

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第6898465号  
(P6898465)

(45) 発行日 令和3年7月7日 (2021.7.7)

(24) 登録日 令和3年6月14日 (2021.6.14)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 237/16 (2006.01)

C O 7 D 237/16

C S P

A O 1 N 43/58 (2006.01)

A O 1 N 43/58

B

A O 1 P 13/00 (2006.01)

A O 1 P 13/00

請求項の数 10 (全 98 頁)

(21) 出願番号 特願2019-553038 (P2019-553038)  
 (86) (22) 出願日 平成30年3月28日 (2018.3.28)  
 (65) 公表番号 特表2020-515570 (P2020-515570A)  
 (43) 公表日 令和2年5月28日 (2020.5.28)  
 (86) 国際出願番号 PCT/US2018/024742  
 (87) 国際公開番号 W02018/183432  
 (87) 国際公開日 平成30年10月4日 (2018.10.4)  
 審査請求日 令和3年3月26日 (2021.3.26)  
 (31) 優先権主張番号 62/477,685  
 (32) 優先日 平成29年3月28日 (2017.3.28)  
 (33) 優先権主張国・地域又は機関  
 米国 (US)

早期審査対象出願

(73) 特許権者 391022452  
 エフ エム シー コーポレーション  
 FMC CORPORATION  
 アメリカ合衆国 19104 ペンシルベ  
 ニア州 フィラデルフィア ウォールナッ  
 トストリート2929  
 (74) 代理人 100127926  
 弁理士 結田 純次  
 (74) 代理人 100140132  
 弁理士 竹林 則幸  
 (72) 発明者 マッカン、ステファン フレデリック  
 アメリカ合衆国 デラウェア州 ニュアー  
 ク 19711, オールド ステイボウ  
 レーン 11

最終頁に続く

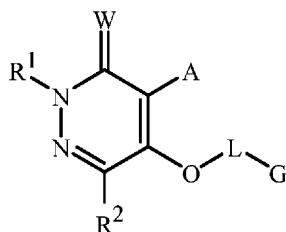
(54) 【発明の名称】 新規ピリダジノン除草剤

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 1 の化合物、その立体異性体、N - オキシド、及び塩であって、

【化 1】



1

式中、

W が、O 又は S であり、

R<sup>1</sup> が、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルカルボニルアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシカルボニルアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキルシクロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> シアノアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ニトロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルコキシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキルチオアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシ、ベンジル

又はフェニルであるか、あるいは、炭素並びに 1 個以下の O 及び 1 個以下の S から選択される環員を含有する 5 員若しくは 6 員の飽和又は部分飽和複素環であり、

R<sup>2</sup> が、H、ハロゲン、シアノ、ホルミル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルカルボニルアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシカルボニルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキルカルボニルオキシ、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキルシクロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルアミノ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ジアルキルアミノ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> シアノアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ニトロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルコキシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルキルチオ、又は C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコキシカルボニルであるか、あるいは、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル又は C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルで任意に置換されたフェニルであり、

L が、直接結合、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルカンジイル又は C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルケンジイルであり、

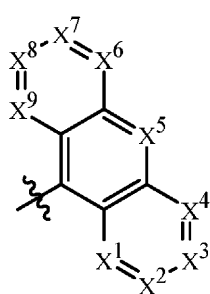
G が、H、C(=O)R<sup>5</sup>、C(=S)R<sup>5</sup>、CO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、C(=O)SR<sup>6</sup>、S(O)<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、S(O)<sub>2</sub>R<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、又は P(=O)R<sup>9</sup>R<sup>10</sup> であるか、あるいは、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルコキシアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、又は C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキルであるか、あるいは、5 員又は 6 員の複素環であり、

A が、

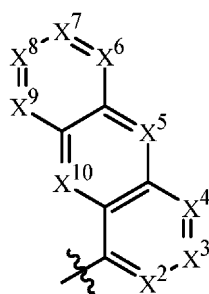
10

20

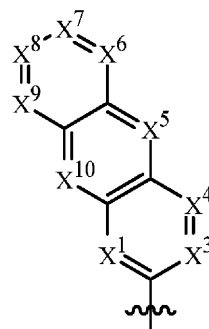
## 【化 2】



A-1

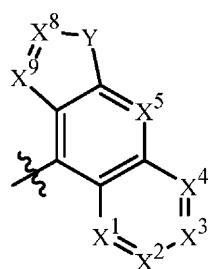


A-2

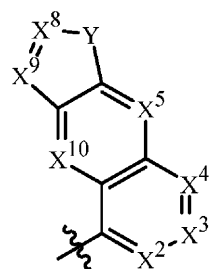


A-3

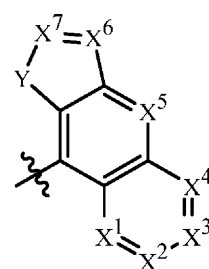
10



A-4

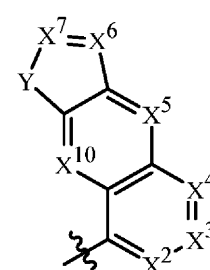


A-5

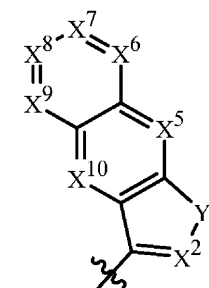


A-6

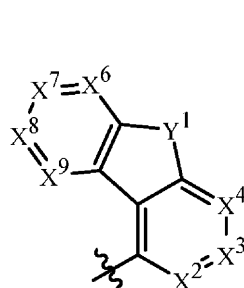
20



A-7



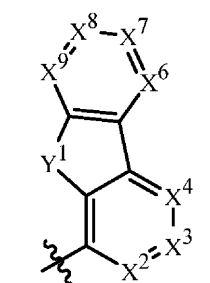
A-8



A-9

及び

30



A-10

40

から選択され、

$X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$ 、 $X^4$ 、 $X^5$ 、 $X^6$ 、 $X^7$ 、 $X^8$ 、 $X^9$ 、及び $X^{10}$ は、それぞれ独立して、N又は $CR^3$ であり、但し、 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$ 、 $X^4$ 、 $X^5$ 、 $X^6$ 、 $X^7$ 、 $X^8$ 、 $X^9$ 、及び $X^{10}$ のうちの4個以下が、Nであり、

Yが、O、S、又は $NR^4$ であり、

$Y^1$ が、O、S、 $NR^4$ 、又は $CR^{3a}R^{3b}$ であり、

各 $R^3$ が、独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルケニル、 $C_2 \sim C_5$ アルキニル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$ ハ

50

ロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$  アルコキシアリル、 $C_1 \sim C_5$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$  ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$  アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_5$  ハロアルキルチオ、又は $C_2 \sim C_5$  アルコキシカルボニルであり、

$R^{3a}$  が、H、ハロゲン、-CN、ニトロ、 $C_1 \sim C_5$  アルキル、 $C_2 \sim C_5$  アルケニル、 $C_2 \sim C_5$  アルキニル、 $C_3 \sim C_5$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$  シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$  ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$  ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$  ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$  アルコキシアリル、 $C_1 \sim C_5$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$  ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$  アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_5$  ハロアルキルチオ、又は $C_2 \sim C_5$  アルコキシカルボニルであり、

$R^{3b}$  が、H、ハロゲン、-CN、ニトロ、 $C_1 \sim C_5$  アルキル、 $C_2 \sim C_5$  アルケニル、 $C_2 \sim C_5$  アルキニル、 $C_3 \sim C_5$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$  シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$  ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$  ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$  ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$  アルコキシアリル、 $C_1 \sim C_5$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$  ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$  アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_5$  ハロアルキルチオ、又は $C_2 \sim C_5$  アルコキシカルボニルであるか、あるいは、

$R^{3a}$  及び $R^{3b}$  が、=Oとして一緒になるか、あるいは、 $R^{3a}$  及び $R^{3b}$  が、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、任意に置換された3～7員の炭素環を形成し、

$R^4$  が、H、 $C_1 \sim C_3$  アルキル、又は $C_1 \sim C_3$  ハロアルキルであり、

$R^5$  及び $R^7$  が、独立して、H、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_7$  アルケニル、 $C_3 \sim C_7$  アルキニル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_7$  ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$  アルコキシアリル、又は $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキルであるか、あるいは、フェニル、ベンジル、又は5～6員の複素環であり、各フェニル、ベンジル、又は複素環が、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、又は $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルで任意に置換されており、

$R^6$  が、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_7$  アルケニル、 $C_3 \sim C_7$  アルキニル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_2 \sim C_7$  ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$  アルコキシアリル、又は $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキルであるか、あるいは、フェニル、ベンジル、又は5～6員の複素環であり、各フェニル、ベンジル、又は複素環が、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、又は $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルで任意に置換されており、

$R^8$  が、H、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_2 \sim C_7$  アルケニル、 $C_2 \sim C_7$  アルキニル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_7$  ハロアルキル、又は $C_2 \sim C_7$  アルコキシアリルであり、

$R^9$  が、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、又は $C_1 \sim C_7$  アルコキシであり、

$R^{10}$  が、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、又は $C_1 \sim C_7$  アルコキシである、化合物、その立体異性体、N-オキシド、及び塩。

#### 【請求項2】

$R^1$  が、H、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_8$  アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 \sim C_8$  アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$  アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$  アルケニル、 $C_3 \sim C_7$  アルキニル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$  シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$  ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_7$  ハロアルコキシアリル、 $C_1 \sim C_7$  ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$  アルコキシアリル、 $C_3 \sim C_7$  アルキルチオアルキル、 $C_1 \sim C_7$  アルコキシ、ベンジル又はフェニルであり、

Wが、Oであり、

Aが、A-1、A-4及びA-6から選択され、

Lが、直接結合であり、

10

20

30

40

50

Gが、H、C(=O)R<sup>5</sup>、C(=S)R<sup>5</sup>、CO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、C(=O)SR<sup>6</sup>、CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、又はP(=O)R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>であるか、あるいは、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキニル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、又はC<sub>4</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキルアルキルであり、

R<sup>2</sup>が、H、ハロゲン、シアノ、ホルミル、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>アルキルカルボニルアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシカルボニルアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルキルカルボニルオキシ、C<sub>4</sub>～C<sub>7</sub>アルキルシクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>アルケニル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルアミノ、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>ジアルキルアミノ、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキル、C<sub>4</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキルアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ニトロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>ハロアルコキシアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシ、又はC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルキルチオであり、

各R<sup>3</sup>が、独立して、H、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>4</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>ハロアルキル、又はC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシである、請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項3】

R<sup>1</sup>が、H、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシカルボニルアルキル、C<sub>4</sub>～C<sub>7</sub>アルキルシクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキル、C<sub>4</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキルアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ニトロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>ハロアルコキシアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub>ハロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>アルキルチオアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシ、又はベンジルであり、

Aが、A-1であり、

Gが、H、C(=O)R<sup>5</sup>、CO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、又はP(=O)R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>であるか、あるいは、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルケニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、又はC<sub>4</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキルアルキルであり、

R<sup>2</sup>が、H、ハロゲン、シアノ、ホルミル、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルキルカルボニルオキシ、C<sub>4</sub>～C<sub>7</sub>アルキルシクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルアミノ、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキル、C<sub>4</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキルアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ニトロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>ハロアルコキシアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub>ハロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシアルキル、又はC<sub>1</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシであり、

各R<sup>3</sup>が、独立して、H、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルキル、シクロプロピル、又はC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>ハロアルキルである、請求項2に記載の化合物。

#### 【請求項4】

R<sup>1</sup>が、

C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>4</sub>シクロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>ハロアルキル、又はC<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシアルキルであり、

Gが、H、C(=O)R<sup>5</sup>、CO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、又はP(=O)R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>であるか、あるいは、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシアルキル、又はC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり、

R<sup>2</sup>が、H、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>5</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシアルキル、又はC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシであり、

各R<sup>3</sup>が、独立して、H、ハロゲン、メチル、エチル、又はCF<sub>3</sub>である、請求項3に記載の化合物。

#### 【請求項5】

10

20

30

40

50

$R^1$  が、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、又は2-メトキシエチルであり、  
 $G$  が、 $H$ 、 $C(=O)R^5$ 、又は $CO_2R^6$ であるか、あるいは、 $C_2 \sim C_4$  アルコキシアルキル、又は $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルであり、  
 $R^2$  が、 $H$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $-CN$ 、メチル、又はメトキシであり、  
 各  $R^3$  が、独立して、 $H$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、又はメチルである、請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

4-(9-アントラセニル)-6-クロロ-5-ヒドロキシ-2-メチル-3(2H)-ピリダジノン、

6-クロロ-4-(10-クロロ-9-アントラセニル)-5-ヒドロキシ-2-メチル-3(2H)-ピリダジノン、及び

4-(10-ブromo-9-アントラセニル)-6-クロロ-5-ヒドロキシ-2-メチル-3(2H)-ピリダジノンからなる群から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物と、界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1つの構成成分と、を含む、除草組成物。

【請求項8】

請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物と、他の除草剤及び除草剤毒性緩和剤からなる群から選択される少なくとも1つの追加の有効成分と、界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1つの構成成分と、を含む、除草組成物。

【請求項9】

(a) 請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物と、(b)(b1) 光化学系II 阻害剤、(b2) アセトヒドロキシ酸シンターゼ(AHAS) 阻害剤、(b3) アセチル-CoAカルボキシラーゼ(ACCase) 阻害剤、(b4) オーキシシン模倣体、(b5) 5-エノール-ピルピルシキミ酸-3-リン酸(EPPS) シンターゼ阻害剤、(b6) 光化学系II 電子ダイバータ、(b7) プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼ(PPO) 阻害剤、(b8) グルタミンシンターゼ(GS) 阻害剤、(b9) 超長鎖脂肪酸(VLCFA) エロンガーゼ阻害剤、(b10) オーキシシン輸送阻害剤、(b11) フィトエンデサチュラーゼ(PDS) 阻害剤、(b12) 4-ヒドロキシフェニル-ピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPD) 阻害剤、(b13) ホモゲンチジン酸ソラネシルトランスフェラーゼ(HST) 阻害剤、(b14) セルロース生合成阻害剤、(b15) 有糸分裂攪乱物質、有機ヒ素剤、アシュラム、プロモブチド、シンメチリン、クミルロン、ダゾメット、ジフェンゾコート、ダイムロン、エトベンザニド、フルレノール、ホサミン、ホサミン-アンモニウム、ヒダントシジン、メタム、メチルダイムロン、オレイン酸、オキサジクロメホン、ペラルゴン酸及びピリブチカルブを含む他の除草剤、及び、(b16) 除草剤毒性緩和剤；並びに、(b1)～(b16)の化合物の塩から選択される少なくとも1つの追加の有効成分と、を含む除草剤混合物。

【請求項10】

望ましくない植生の成長を防除する方法であって、前記植生又はその環境に、除草性有効量の請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物、請求項7もしくは8に記載の除草組成物、または請求項9に記載の除草剤混合物を接触させることを含む、方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、特定のピリダジノン除草剤、そのN-オキシド、塩及び組成物、並びに望ましくない植生を防除するためのその使用方法に関する。

【背景技術】

【0002】

望ましくない植生の防除は、高収穫効率を達成するのに極めて重要である。とりわけ

10

20

30

40

50

コメ、大豆、サトウダイコン、トウモロコシ、ジャガイモ、小麦、大麦、トマト及びプランテーション作物などの、特に有用な作物における雑草の成長を選択的に防除することが極めて望ましい。このような有用な作物において雑草の成長を野放しにしておいた場合には、生産性が顕著に低下し、これにより、消費者に対するコストが増加してしまう可能性がある。非農耕領域 (noncrop areas) における望ましくない植生の防除もまた重要である。多くの製品がこれらの目的のために市販されているが、より効果的であり、より安価であり、毒性が低く、環境に優しく、又は、異なる作用部位を有する新規化合物に対する需要が継続している。

【発明の概要】

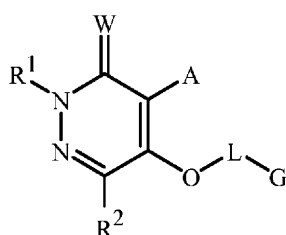
【0003】

10

本発明は、全ての立体異性体、そのN-オキンド、及び塩を含む式1の化合物、それを含む農業組成物、及び除草剤としてのその使用を目的とし、

【0004】

【化1】



20

1

式中、

WはO又はSであり、

R<sup>1</sup>は、H、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>アルキルカルボニルアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシカルボニルアルキル、C<sub>4</sub>～C<sub>7</sub>アルキルシクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>アルケニル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキル、C<sub>4</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキルアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ニトロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>ハロアルコキシアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>アルキルチオアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシ、ベンジル又はフェニルであるか、あるいは、炭素並びに1個以下のO及び1個以下のSから選択される環員を含む5員若しくは6員の飽和又は部分飽和複素環であり、

30

R<sup>2</sup>は、H、ハロゲン、シアノ、ホルミル、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>アルキルカルボニルアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシカルボニルアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルキルカルボニルオキシ、C<sub>4</sub>～C<sub>7</sub>アルキルシクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>アルケニル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルアミノ、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>ジアルキルアミノ、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキル、C<sub>4</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキルアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ニトロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>ハロアルコキシアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルキルチオ、又はC<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシカルボニルであるか、あるいは、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルで任意に置換されたフェニルであり、

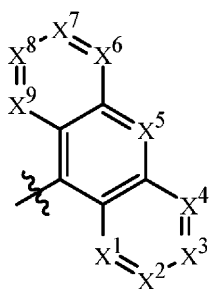
40

Lは、直接結合、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルカンジイル又はC<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルケンジイルであり、

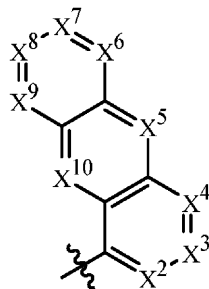
Gは、H、C(=O)R<sup>5</sup>、C(=S)R<sup>5</sup>、CO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、C(=O)SR<sup>6</sup>、S(O)<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、S(O)<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、又はP(=O)R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>であるか、あるいは、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキニル、C<sub>2</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、又はC<sub>4</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキルアルキルであるか、あるいは、5員又は6員の複素環であり、

50

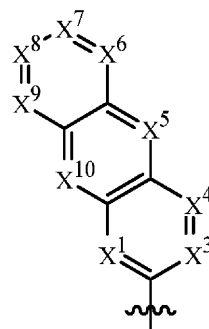
Aは、  
【 0 0 0 5 】  
【 化 2 】



A-1

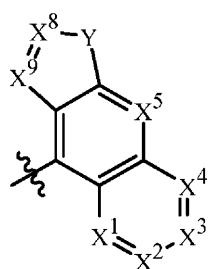


A-2

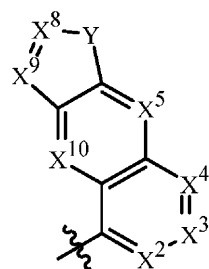


A-3

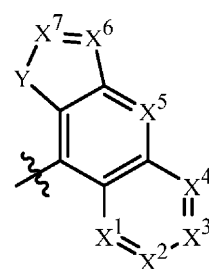
10



A-4

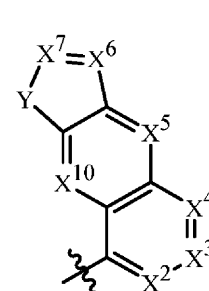


A-5

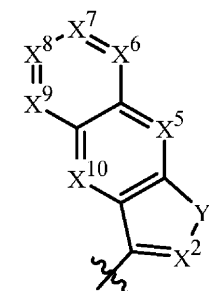


A-6

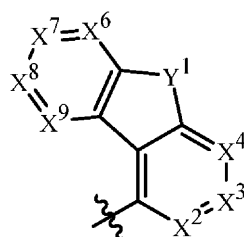
20



A-7



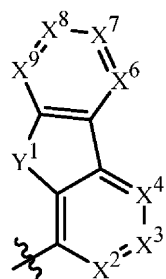
A-8



A-9

及び

30



A-10

40

から選択され、

$X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$ 、 $X^4$ 、 $X^5$ 、 $X^6$ 、 $X^7$ 、 $X^8$ 、 $X^9$ 、及び $X^{10}$ は、それぞれ独立して、N又は $CR^3$ であり、但し、 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$ 、 $X^4$ 、 $X^5$ 、 $X^6$ 、 $X^7$ 、 $X^8$ 、 $X^9$ 、及び $X^{10}$ のうちの4個以下が、Nであり、

Yは、O、S、又は $NR^4$ であり、

$Y^1$ は、O、S、 $NR^4$ 、又は $CR^{3a}R^{3b}$ であり、

各 $R^3$ は、独立して、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_2 \sim$

50



C<sub>5</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>5</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>5</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルキニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルキルチオ、又はC<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシカルボニルであり、

R<sup>3a</sup> は、H、ハロゲン、-CN、ニトロ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>5</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>5</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルキニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルキルチオ、又はC<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシカルボニルであり、

10

R<sup>3b</sup> は、H、ハロゲン、-CN、ニトロ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>5</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>5</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルキニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルキルチオ、又はC<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシカルボニルであり、あるいは、

R<sup>3a</sup> 及び R<sup>3b</sup> が、=Oとして一緒になるか、あるいは、R<sup>3a</sup> 及び R<sup>3b</sup> が、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、任意に置換された3 ~ 7員の炭素環を形成し、

20

R<sup>4</sup> が、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキル、又はC<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> ハロアルキルであり、

R<sup>5</sup> 及び R<sup>7</sup> は、独立して、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシアルキル、又はC<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキルであるか、あるいは、フェニル、ベンジル、又は5 ~ 6員の複素環であり、各フェニル、ベンジル、又は複素環が、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、又はC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルで任意に置換されており、

R<sup>6</sup> は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシアルキル、又はC<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキルであるか、あるいは、フェニル、ベンジル、又は5 ~ 6員の複素環であり、各フェニル、ベンジル、又は複素環が、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、又はC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルで任意に置換されており、

30

R<sup>8</sup> が、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルキル、又はC<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシアルキルであり、

R<sup>9</sup> が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキル、又はC<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシであり、

R<sup>10</sup> が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキル、又はC<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシである。

40

#### 【0006】

より具体的には、本発明は、式1の化合物(全ての立体異性体を含む)、そのN-オキシド又は塩に関する。本発明はまた、本発明の化合物(すなわち、除草性有効量で)と、界面活性剤、固体希釈剤(solid diluent)及び液体希釈剤(liquid diluent)からなる群から選択される少なくとも1つの構成成分とを含む除草組成物(herbicidal composition)に関する。本発明は更に、植生又はその環境に除草性有効量の本発明の化合物(例えば、本明細書に記載の組成物として)を接触させることを含む望ましくない植生の成長を防除する方法に関する。

#### 【0007】

本発明はまた、(a)式1から選択される化合物、そのN-オキシド及び塩と、(b

50

）以下に記載される（b 1）～（b 1 6）から選択される少なくとも１つの追加の有効成分、並びに（b 1）～（b 1 6）の化合物の塩とを含む除草剤混合物を包含する。

【発明を実施するための形態】

【0008】

本明細書で使用する場合、用語「～を含む（comprises、comprising）」、「～を含む（includes、including）」、「～を有する（has、having）」、「～を含有する（contains、containing）」、「～を特徴とする」、又はこれらの任意の他のバリエーションは、明示的に示されるあらゆる制限を受けて、非排他的な包含に及ぶことが意図される。例えば、要素の一覧を含む組成物、混合物、プロセス又は方法は、必ずしもそれらの要素のみに限定されるものではないものの、明示的に示されていない他の要素、又はそのような組成物、混合物、プロセス、若しくは方法に固有の他の要素を含んでよい。

10

【0009】

移行句「～からなる」は、明記されていないあらゆる要素、工程、又は成分を除外する。請求項に存在する場合、その語句は請求項を、通常関連する不純物を除いて、引用されるもの以外の材料を含めなくする。語句「～からなる」が、プリアンプルの直後に続くのではなく、請求項本体の節に現れる場合、この語句は、その節で説明される要素のみを限定し、他の要素は、特許請求の範囲全体から除外されない。

【0010】

移行句「～から本質的になる」は、文字どおりに開示されているものに加えて、材料、工程、特徴、構成成分、又は要素を含む組成物又は方法を定義するために使用される。但し、これらの追加の材料、工程、特徴、構成成分、又は要素は、特許請求された発明の基本的かつ新規の特徴（複数可）に、実質的に影響を及ぼすものではない。用語「～から本質的になる」は、「～を含む」と「～からなる」との中間の立場を占めている。

20

【0011】

出願人らが、「～を含む（comprising）」などのオープンエンドの用語により、発明又はその一部を定義している場合、（別様に記載されない限り）その説明は、用語「～から本質的になる（consisting essentially of）」又は「～からなる（consisting of）」を用いた発明もまた説明するように解釈されるべきであることが容易に理解されるべきである。

【0012】

更に、逆の意味が明示的に記載されない限り、「又は」は、包括的な「又は」を指し、排他的な「又は」を指すものではない。例えば、条件A又はBは、以下のいずれか１つにより満たされる：Aが真であり（又は存在し）、かつBが偽である（又は存在しない）、Aが偽であり（又は存在せず）、かつBが真である（又は存在する）、並びに、A及びBの両方が真である（又は存在する）。

30

【0013】

また、本発明の要素又は構成成分に先行する不定冠詞「a」及び「an」は、要素又は構成成分の例（即ち、発生）の数に関して非限定的であることが意図される。それ故、「a」又は「an」は１つ、又は少なくとも１つを含むように読解されなければならない、その要素又は構成成分の単数形は、その数が明らかに単数であることを意味する場合を除いて、複数もまた含む。

40

【0014】

本明細書で言及するとき、単独で又は複合語で用いられる「実生」という用語は、種子の胚芽から成長する幼植物を意味する。

【0015】

本明細書で言及するとき、単独で、又は、「広葉雑草」などの用語において用いられる「広葉」という用語は、双子葉植物（dicot又はdicotyledon）を意味し、２つの子葉を有する胚を特徴とする被子植物の群を説明する用語を意味する。

【0016】

本明細書で使用するとき、「アルキル化（alkylating）」という用語は、炭素含有ラ

50

ジカルから求核剤がハロゲン化物又はスルホネートなどの脱離基を置換する反応を指す。別途記載のない限り、「アルキル化」という用語によって、炭素含有ラジカルがアルキルに限定されることはない。

#### 【 0 0 1 7 】

上記の言及において、単独で、又は、「アルキルチオ」若しくは「ハロアルキル」などの複合語で用いられる「アルキル」という用語は、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル又は異なるブチル、ペンチル又はヘキシル異性体などの直鎖又は分枝鎖アルキルを含む。「アルケニル」は、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、及び異なるブテニル、ペンテニル並びにヘキセニル異性体などの直鎖又は分枝鎖アルケンを含む。「アルケニル」はまた、1, 2-プロパジエニル及び2, 4-ヘキサジエニルなどのポリエ

10

ンを含む。「アルキニル」は、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル及び異なるブチニル、ペンチニル及びヘキシニル異性体などの直鎖又は分枝鎖アルキンを含む。「アルキニル」はまた、2, 5-ヘキサジニルなどの複数の三重結合を含む部分を含むこともできる。

#### 【 0 0 1 8 】

「アルコキシ」は、例えば、メトキシ、エトキシ、*n*-プロピルオキシ、イソプロピルオキシ及び異なるブトキシ、ペントキシ並びにヘキシルオキシ異性体を含む。「アルコキシアルキル」は、アルキル上のアルコキシ置換を表す。「アルコキシアルキル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、及び $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ が挙げられる。「アルコキシ」は、アルコキシ上のアルコキシ置換を表す。「アルキルチオ」は、メチルチオ、エチルチオ及び異なるプロピルチオ、ブチルチオ、ペンチルチオ並びにヘキシルチオ異性体などの分枝鎖又は直鎖アルキルチオ部分を含む。「アルキルチオアルキル」は、アルキル上のアルキルチオ置換を表す。「アルキルチオアルキル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、及び $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ が挙げられる。「アルキルスルフィニル」は、アルキルスルフィニル基の両方の鏡像異性体を含む。「アルキルスルフィニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})-$ 、及び異なるブチルスルフィニル、ペンチルスルフィニル及びヘキシルスルフィニル異性体が挙げられる。「アルキルスルホニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2-$ 、及び異なるブチルスルホニル、ペンチルスルホニル、並びにヘキシルスルホニル異性体が挙げられる。「シアノアルキル」は、1つのシアノ基で置換されたアルキル基を表す。「シアノアルキル」の例としては、 $\text{NCCH}_2$ 及び $\text{NCCH}_2\text{CH}_2$ （代替的に、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$ として特定される）が挙げられる。「ニトロアルキル」は、1つのニトロ基で置換されたアルキル基を表す。「ニトロアルキル」の例としては、 $\text{O}_2\text{NCH}_2$ 及び $\text{O}_2\text{NCH}_2\text{CH}_2$ （代替的に、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NO}_2$ として特定される）が挙げられる。「シアノ」は、 $\text{NC}-$ を意味し、「ホルミル」は $\text{HC}(=\text{O})-$ を意味する。「アルキルアミノ」は、直鎖又は分枝鎖アルキルで置換された $\text{NH}$ 基を含む。「アルキルアミノ」の例としては、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NH}$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}$ 、及び $(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}_2\text{NH}$ が挙げられる。「ジアルキルアミノ」の例としては、 $(\text{CH}_3)_2\text{N}$ 、 $(\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2)_2\text{N}$ 、及び $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)_2\text{N}$ が挙げられる。

20

30

40

#### 【 0 0 1 9 】

「シクロアルキル」には、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、及びシクロヘキシルが含まれる。「シクロアルキルアルキル」という用語はアルキル部分上のシクロアルキル置換を表す。「シクロアルキルアルキル」の例としては、シクロプロピルメチル、シクロペンチルエチル、及び直鎖又は分枝鎖アルキル基に結合した他のシクロアルキル部分が挙げられる。「アルキルシクロアルキル」という用語は、シクロアルキル部分に結合したアルキル基を表す。

#### 【 0 0 2 0 】

50

「ハロゲン」という用語は、単独若しくは「ハロアルキル」などの複合語で、又は、「ハロゲンで置換されたアルキル」などの記載において用いられる場合、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を含む。更に、「ハロアルキル」などの複合語で用いられた場合、又は、「ハロゲンで置換されたアルキル」などの記載において用いられた場合、当該アルキルは、同一であっても異なってもよいハロゲン原子で部分的又は完全に置換されていてもよい。「ハロアルキル」又は「ハロゲンで置換されたアルキル」の例としては、 $\text{F}_3\text{C}$ 、 $\text{ClCH}_2$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2$ 、及び $\text{CF}_3\text{CCl}_2$ が挙げられる。「ハロアルコキシ」、「ハロアルコシアルキル」、「ハロアルキルチオ」、「ハロアルケニル」、「ハロアルキニル」などという用語は、「ハロアルキル」という用語と同様に定義される。「ハロアルコキシ」の例としては、 $\text{CF}_3\text{O}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、及び $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}-$ が挙げられる。「ハロアルコシアルキル」の例としては、 $\text{CF}_3\text{OCH}_2-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、及び $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ が挙げられる。「ハロアルキルチオ」の例としては、 $\text{CCl}_3\text{S}-$ 、 $\text{CF}_3\text{S}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}-$ 及び $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ が挙げられる。「ハロアルケニル」の例としては、 $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2-$ 及び $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$ が挙げられる。「ハロアルキニル」の例としては、 $\text{HC}(\text{Cl})\text{CH}_2-$ 、 $\text{CF}_3\text{C}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{C}-$ 、及び $\text{FCH}_2\text{C}(\text{Cl})\text{CH}_2-$ が挙げられる。

#### 【0021】

「アルキルカルボニル」は、 $\text{C}(=\text{O})$ 部分に結合した直鎖又は分枝鎖アルキル部分を示す。「アルキルカルボニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})-$ 、及び異なるブトキシ-又はペントキシカルボニル異性体が挙げられる。「アルコキシカルボニル」は、 $\text{C}(=\text{O})$ 部分に結合した直鎖又は分枝鎖アルコキシ部分を示す。「アルコキシカルボニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})-$ 、及び異なるブトキシ-又はペントキシカルボニル異性体が挙げられる。「アルコキシカルボニルアルキル」という用語は、アルキル部分を介して結合した直鎖又は分枝鎖アルコキシ部分を示す (denotes a denotes)。「アルキルカルボニルアルキル」という用語は、アルキル部分を介して結合した直鎖又は分枝鎖アルキルカルボニル部分を示す。「アルキルカルボニルオキシ」という用語は、アルキルカルボニルオキシの酸素実施例を介して結合したアルキルカルボニル部分を供与することは、 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ 及び $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})\text{O}-$ が挙げられる。アルカンジイル又はアルケンジイルという用語は、それぞれ直鎖又は分枝鎖アルカン若しくはアルケン連結鎖を指す。アルカンジイルの例としては、 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)-$ 又は $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ が挙げられる。アルケンジイルの例としては、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}=\text{CH}-$ 、又は $-\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)-$ が挙げられる。置換基の位置を特定する文脈において「隣接する」という用語は、「次に」又は「すぐ次に」を意味する。

#### 【0022】

置換基中の炭素原子の総数は、接頭辞「 $\text{C}_i \sim \text{C}_j$ 」により表され、式中*i*及び*j*は1～7の数である。例えば、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルスルホニルは、メチルスルホニルからブチルスルホニルを表し、 $\text{C}_2$ アルコシアルキルは、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2-$ を表し、 $\text{C}_3$ アルコシアルキルは、例えば、 $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)-$ 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ 、又は $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ を表し、 $\text{C}_4$ アルコシアルキルは、合計4個の炭素原子を含有するアルコキシ基で置換されたアルキル基の様々な異性体を表し、例えば、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 及び $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ を含む。

#### 【0023】

基が水素であり得る置換基、例えば $\text{R}^2$ 又は $\text{R}^4$ を含有する場合、この置換基が水素として取り込まれる場合、この置換基は、非置換である当該基と同等であることが認識される。基上の1つ以上の位置が「置換されていない」又は「非置換」といわれる場

10

20

30

40

50

合、水素原子は、任意の遊離原子価を取るよう結合される。任意に置換されているとして別段の指示がない限り、「フェニル」という用語は、非置換フェニルを意味する。任意に置換されているとして別段の指示がない限り、「ベンジル」という用語は、非置換ベンジルを意味する。

【0024】

Lが直接結合であり、かつGがHである式1の化合物（すなわち、式1の「O-L-G」置換基がヒドロキシ部分である）は、植物酵素又は受容体上の活性部位に結合して、植物に除草効果をもたらす化合物であると考えられている。置換基L-Gが、植物又は環境内でヒドロキシ部分に変換され得る基を形成する他の式1の化合物は、同様の除草効果をもたらすとともに本発明の範囲内である。したがって、L-Gは、当該技術分野において既知のいずれかの誘導体であって、式1の化合物の除草活性を喪失させることがなく、かつ、植物又は土壌中において加水分解、酸化、還元、ないしは別の方法で代謝されて、pHに応じて解離形態若しくは非解離形態であるカルボン酸官能基（carboxylic acid function）をもたらすか、又はもたらすことができる誘導体であり得る。「環系」という用語は、2つ以上の縮合環を表す。「二環系」という用語は、2つの縮合環からなる環系を表す。

10

【0025】

本発明の化合物は、1つ以上の立体異性体として存在し得る。様々な立体異性体としては、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロブ異性体、及び幾何異性体が挙げられる。立体異性体は、構成が同じであるが、空間での原子配置が異なる異性体であり、エナンチオマー、ジアステレオマー、cis-trans異性体（幾何異性体としても知られている）、及びアトロブ異性体が挙げられる。アトロブ異性体は、回転障壁が、異性体種の分離を可能にするのに十分高い単結合を中心にした、回転が制限されることにより生じる。当業者であれば、1種の立体異性体が他の立体異性体（複数可）と比較して富化された場合に、又は、他の立体異性体（複数可）から分離された場合に、より活性であり得及び/又は有益な効果を発揮し得ることを理解するであろう。更に、当業者であれば、当該立体異性体を分離し、富化し、かつ/又は選択的に調製する方法を知っている。本発明の化合物は、立体異性体の混合物、個別の立体異性体として、又は光学的に活性な形態として存在してもよい。

20

【0026】

式1の化合物は、典型的には2種類以上の形態で存在し、それ故、式1は、これらが表す化合物の全ての結晶性及び非結晶形態を含む。非結晶形態としては、蠟及びゴムなどの、固体である実施形態、並びに、溶液及び溶融物（melt）などの液体である実施形態が挙げられる。結晶形態としては、本質的に単結晶型を表す実施形態、及び多形体（即ち、異なる結晶の種類）の混合物を表す実施形態が挙げられる。「多形体」という用語とは、異なる結晶形態で結晶化可能な、化学化合物の特定の結晶形態、結晶格子内の分子が異なる配置及び/又は構造を有する、これらの形態を意味する。多形体は同一の化学的組成を有することができるものの、これらはまた、格子内で弱く、又は強く結合可能な、共結晶化された水又は他の分子の有無により、組成物中で異なることもあり得る。多形体は、結晶の形状、密度、硬さ、色、化学的安定性、融点、吸湿性、懸濁性、溶解速度及び生物学的利用可能性と同様にこのような化学的、物理的及び生物学的特性が異なっていることが可能である。当業者は、式1の化合物の多形体が、式1の同一の化合物の他の多形体又は多形体の混合物に対して、有益な効果（例えば、有用な配合物の調製に対する適合性、向上した生物学的性能）を示すことができることを理解するであろう。式1の化合物の特定の多形体の調製及び単離は、例えば、選択した溶媒及び温度を使用する結晶化を含む、当業者に既知の方法により行うことができる。多型の包括的な議論については、R. Hilfiker, Ed., Polymorphism in the Pharmaceutical Industry, Wiley-VCH, Weinheim, 2006を参照されたい。

30

40

【0027】

50

当業者は、窒素が、酸化してオキシドになるために、利用可能な非共有電子対を必要とするため、全ての窒素含有複素環が、N - オキシドを形成可能であるわけではないことを理解するであろう。当業者は、N - オキシドを形成することができる窒素含有複素環を理解するであろう。当業者はまた、三級アミンがN - オキシドを形成することができることを理解するであろう。複素環類及び三級アミンのN - オキシドを調製するための合成方法は、複素環及び三級アミンを、過酢酸及びm - クロロ過安息香酸 (MCPBA) などのペルオキシ酸；過酸化水素；t - ブチルヒドロペルオキシドなどのアルキルヒドロペルオキシド；過ホウ酸ナトリウム；並びにジメチルジオキシランを用いて酸化することを含めて、当業者に周知である。N - オキシドの調製のためのこれらの方法は、文献中において広範に記載及び概説されており、例えば：T. L. Gilchrist, *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748 - 750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik, *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18 - 20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimm et al. and B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149 - 161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285 - 291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press; 及び、G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390 - 392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Pressを参照されたい。

#### 【0028】

当業者は、環境下及び生理学的条件下では、化学化合物の塩がそれらの対応する非塩形態 (nonsalt forms) と平衡状態にあるため、塩が非塩形態の生物学的有用性を共有することを認識している。したがって、式1の化合物の多種多様な塩は、望ましくない植生の防除に有用である (すなわち、農業的に好適である)。式1の化合物の塩としては、臭化水素酸、塩酸、硝酸、リン酸、硫酸、酢酸、酪酸、フマル酸、乳酸、マレイン酸、マロン酸、シュウ酸、プロピオン酸、サリチル酸、酒石酸、4 - トルエンスルホン酸、又は吉草酸などの無機酸又は有機酸との酸付加塩が挙げられる。式1の化合物がエノール官能基 (enolic function) などの酸性部分を含有する場合 (例えば、Lが直接結合であり、かつGがHである場合)、塩もまた、ピリジン、トリエチルアミン、若しくはアンモニア、又はナトリウム、カリウム、リチウム、カルシウム、マグネシウム、又はバリウムのアミド、水素化物、ヒドロキシド、若しくはカーボネートなどの、有機塩基又は無機塩基により形成したものを含む。したがって、本発明は、式1から選択される化合物、そのN - オキシド、及び農業的に好適な塩から選択される化合物を含む。

#### 【0029】

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>又はR<sup>7</sup>が5員又は6員の窒素含有複素環である場合、別途記載のない限り、式1の残部 (remainder) に、任意の利用可能な炭素又は窒素環原子を介して結合してもよい。上記のように、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>又はR<sup>7</sup>は、本発明の概要で定義される置換基の群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換された (とりわけ) フェニルであってもよい。1 ~ 5個の置換基で任意に置換されたフェニルの例は別紙1におけるU - 1として示される環であり、式中、R<sup>v</sup>は発明の概要で定義されたR<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>又はR<sup>7</sup>上の置換基であり、rは整数である。

#### 【0030】

上述したように、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>又はR<sup>7</sup>は、本発明の概要に定義される置換基の群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換された、飽和しても不飽和でもよい、(とりわ

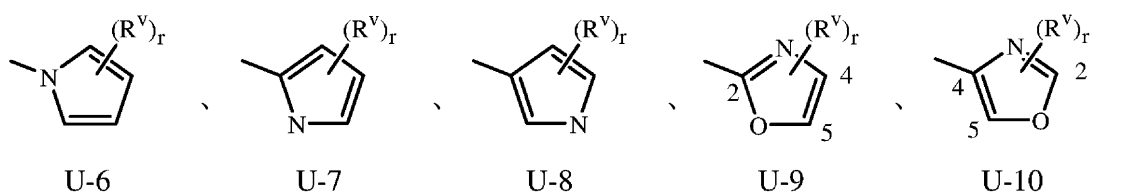
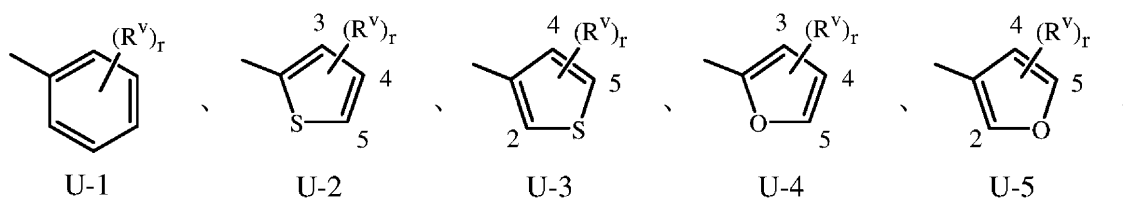
け) 5 員又は 6 員の複素環であってもよい。1 つ以上の置換基で任意に置換された 5 員又は 6 員の不飽和芳香族複素環の例としては、別紙 1 に示される U - 2 ~ U - 61 の環が挙げられ、式中、 $R^v$  は発明の概要で  $R^5$ 、 $R^6$  又は  $R^7$  について定義された任意の置換基(すなわち、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  アルキル又は  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル)であり、 $r$  は 0 ~ 4 の整数であり、これは各 U 基上の利用可能な位置の数によって制限される。U - 29、U - 30、U - 36、U - 37、U - 38、U - 39、U - 40、U - 41、U - 42、及び U - 43 は、1 つの利用可能な位置のみを有し、これら U 基については、 $r$  が整数 0 又は 1 に制限され、 $r$  が 0 であることは、U 基が非置換であり、かつ水素が ( $R^v$ )<sub>r</sub> によって示される位置に存在することを意味する。

【 0 0 3 1 】

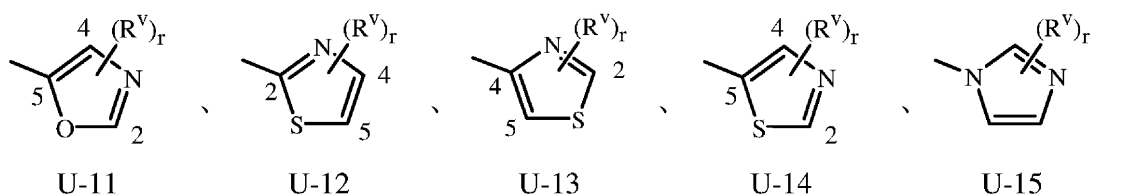
【 化 3 】

10

別紙 1



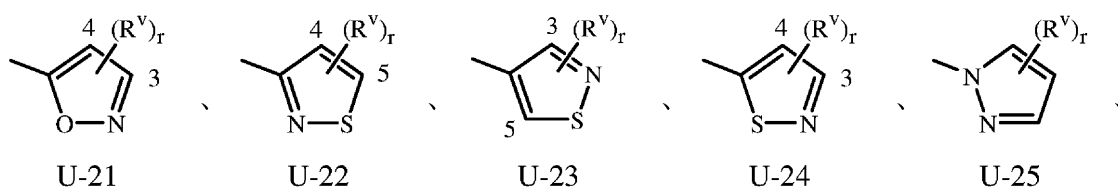
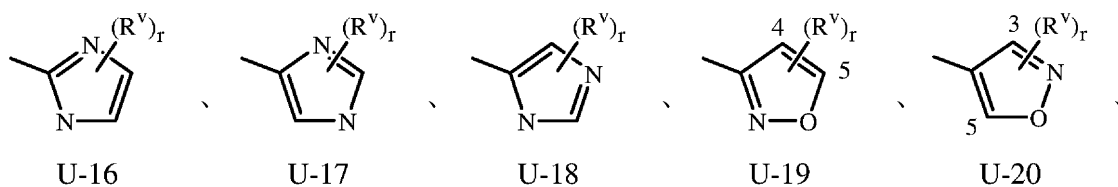
20



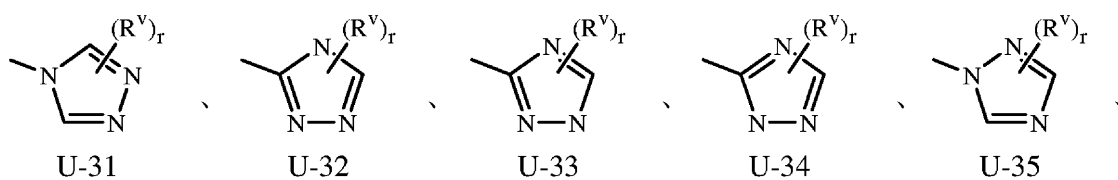
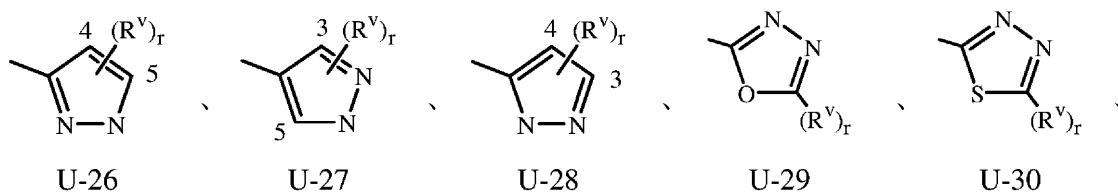
30

【 0 0 3 2 】

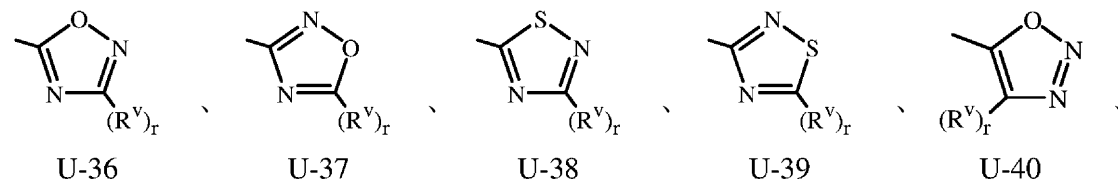
## 【化 4】



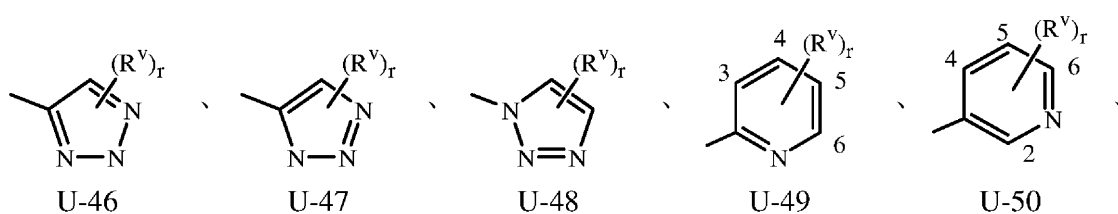
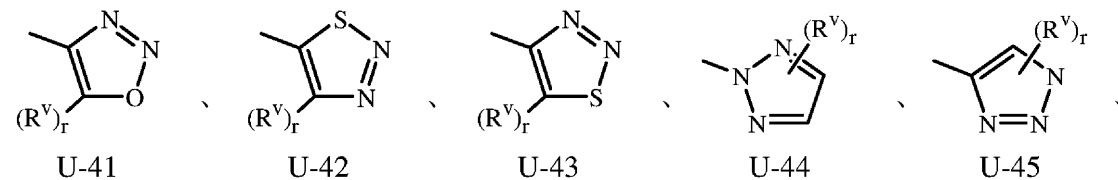
10



20



30

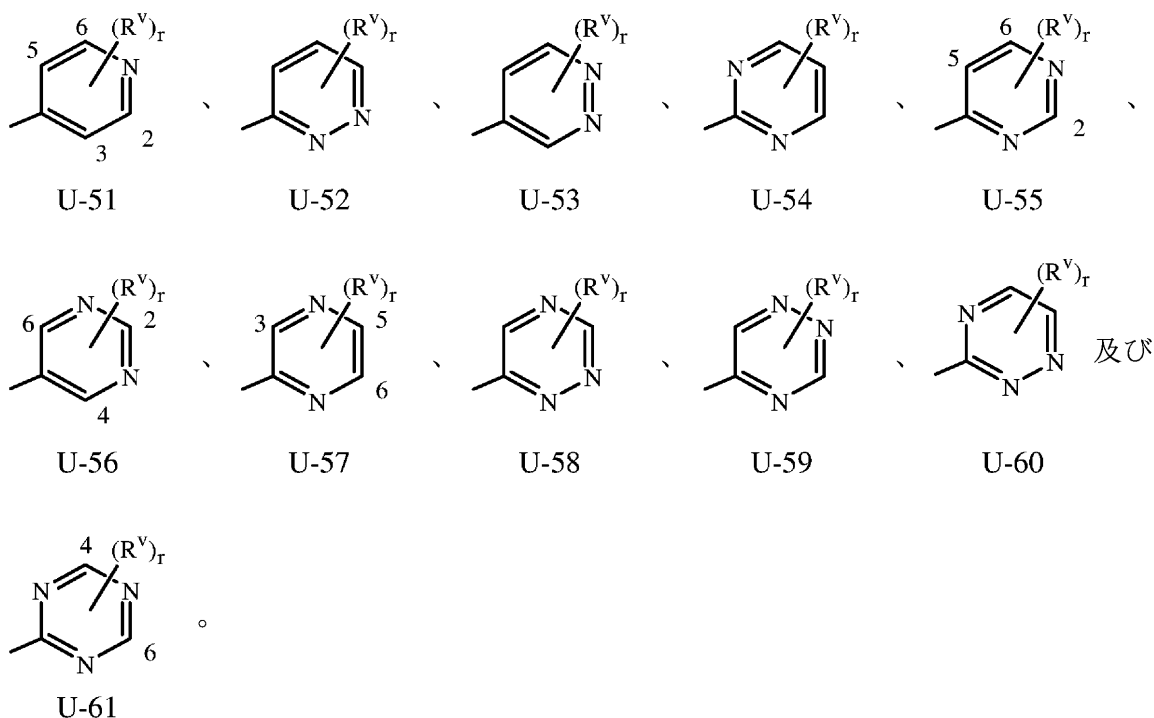


40

【 0 0 3 3 】



## 【化 5】



10

20

## 【 0 0 3 4 】

$R^5$ 、 $R^6$  又は  $R^7$  が、 $R^5$ 、 $R^6$  又は  $R^7$  について発明の概要において定義されたような置換基の群から選択される 1 つ以上の置換基で任意に置換された、5 又は 6 員の飽和若しくは不飽和芳香族複素環である場合により、複素環の 1 又は 2 個の炭素環員は、任意選択的に、カルボニル部分の酸化形態であり得ることに留意されたい。

## 【 0 0 3 5 】

最大で 2 個の O 原子及び最大で 2 個の S 原子から選択される環員を含有する飽和若しくは不飽和芳香族複素環であり、最大 5 個のハロゲン原子を有する炭素原子環員上で任意に置換された 5 員又は 6 員の複素環の例としては、別紙 2 に示されるように、環 T - 1 ~ T - 35 が挙げられる。T 基上の結合点 (attachment point) が浮遊して示されている場合、T 基は、水素原子の置換によって、T 基の任意の利用可能な炭素又は窒素を介して式 1 の残部に結合され得ることに留意されたい。 $R^v$  に対応する任意の置換基は、水素原子を置換することによって、任意の利用可能な炭素又は窒素に結合することができる。これらの T 環に関して、 $r$  は、典型的には 0 ~ 4 の整数であり、これは各 T 基上の利用可能な位置の数によって制限される。「任意に置換された」という用語は、「置換又は非置換」を意味する。 $T^2$  が N である場合、窒素原子は、 $R^5$ 、 $R^6$  又は  $R^7$  について発明の概要において定義されたような H 又は  $R^v$  に対応する置換基のいずれかで置換することによって、その原子価を完全にすることができることに留意されたい。 $R^1$  の例示的な値としては、T - 1、T - 2、T - 7 及び T - 9 (すなわち、 $R^1$  がとりわけ、炭素及び最大 1 個の O 並びに 1 個の S から選択される環員を含有する 5 又は 6 員の飽和若しくは部分飽和複素環である場合) 及び  $T^2$  が O 又は S である T - 28 ~ T 31 が挙げられる。

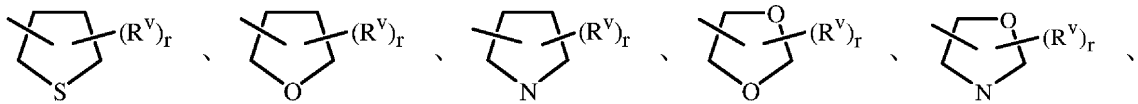
30

40

## 【 0 0 3 6 】

## 【化 6】

## 別紙 2



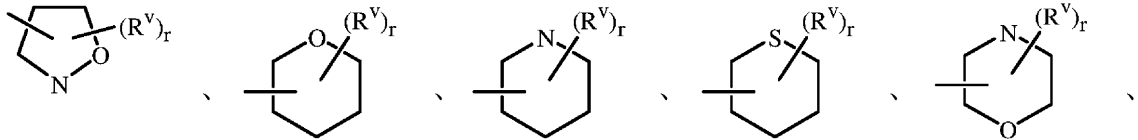
T-1

T-2

T-3

T-4

T-5



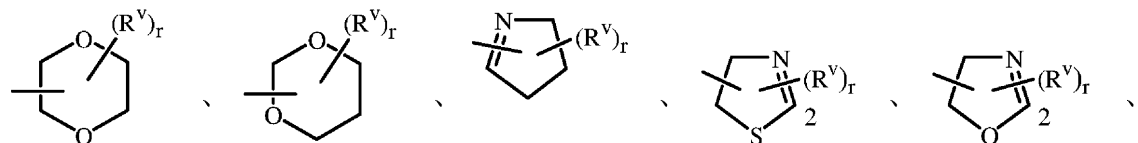
T-6

T-7

T-8

T-9

T-10



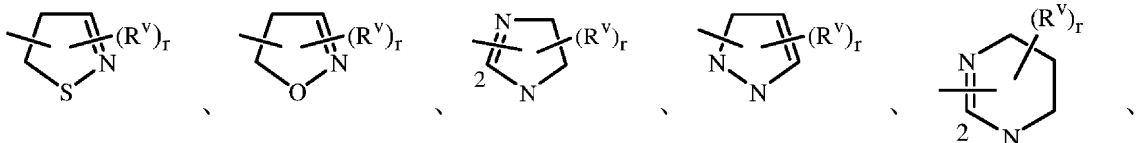
T-11

T-12

T-13

T-14

T-15



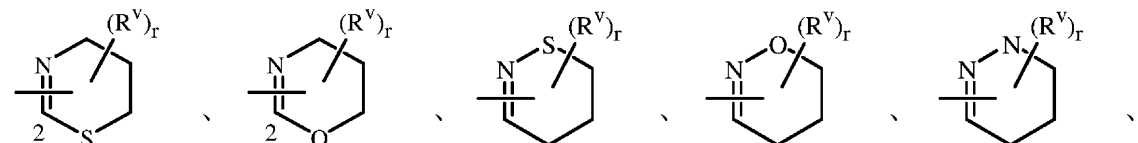
T-16

T-17

T-18

T-19

T-20



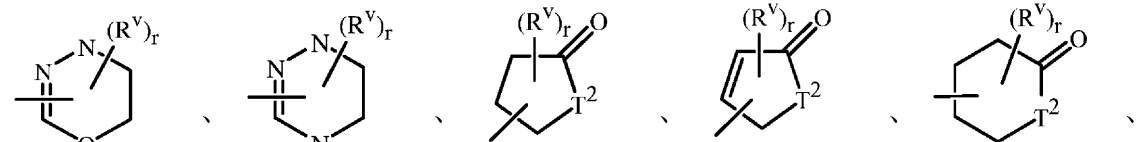
T-21

T-22

T-23

T-24

T-25



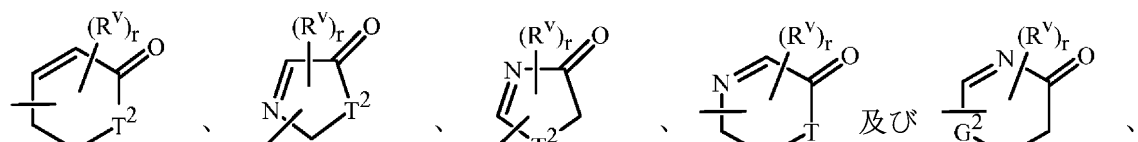
T-26

T-27

T-28

T-29

T-30



T-31

T-32

T-33

T-34

T-35

R<sup>ν</sup>基は構造U - 1 ~ U - 61に示されているが、これらは任意の置換基であるため、存在する必要はないことに留意されたい。原子に結合したときのR<sup>ν</sup>がHである場合、これは当該原子が非置換である場合と同様であることに留意されたい。それらの価数を満たすために置換を必要とする窒素原子は、H又はR<sup>ν</sup>で置換される。(R<sup>ν</sup>)<sub>r</sub>とU基との間の結合点が浮遊として示される場合、(R<sup>ν</sup>)<sub>r</sub>は、U基の任意の利用可能な炭素原子又は窒素原子に結合され得ることに留意されたい。U基上の結合点が浮遊して示されている場合、U基は、水素原子の置換によって、U基の任意の利用可能な炭素又は窒素を介して式1の残部に結合され得ることに留意されたい。いくつかのU基は、4個未満のR<sup>ν</sup>基(例えば、U - 2 ~ U - 5、U - 7 ~ U - 48、及びU - 52 ~ U - 61)で置換され得ることに留意されたい。

10

#### 【0038】

芳香族及び非芳香族複素環並びに環系の調製を可能にするために、多種多様な合成方法が当該技術分野において既知であり、広範なレビューについては、Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984の8巻セット及びComprehensive Heterocyclic Chemistry II, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996の12巻セットを参照されたい。

20

#### 【0039】

本発明の概要に記載されるような本発明の実施形態は、下記を含む(式1を以下の実施形態で使用する場合、そのN - オキシド及び塩を含む)。

#### 【0040】

実施形態1. 式1の化合物、そのN - オキシド及び塩、それらを含む組成物、並びに本発明の概要に記載される望ましくない植生を防除するためのそれらの使用方法。

#### 【0041】

実施形態2. R<sup>1</sup>が、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub>アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>アルキルカルボニルアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>アルコキシカルボニルアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub>アルキルシクロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub>アルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub>アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub>シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub>シクロアルキルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ニトロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub>ハロアルコキシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub>アルコキシアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub>アルキルチオアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub>アルコキシ、ベンジル、又はフェニルである、実施形態1に記載の化合物。

30

#### 【0042】

実施形態3. R<sup>1</sup>が、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub>アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>アルコキシカルボニルアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub>アルキルシクロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub>シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub>シクロアルキルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ニトロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub>ハロアルコキシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub>ハロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub>アルコキシアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub>アルキルチオアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub>アルコキシ、又はベンジルである、実施形態1又は2のいずれか1つに記載の化合物。

40

#### 【0043】

実施形態4. R<sup>1</sup>が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>4</sub>シクロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>ハロアルキル、又はC<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub>アルコキシアルキルである、実施形態3に記載の化合物。

#### 【0044】

実施形態5. R<sup>1</sup>が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>アルキル、NCCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> -、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>ハロアルキル、又は2 - メトキシエチルである、実施形態4に記載の化合物。

#### 【0045】

実施形態6. R<sup>1</sup>が、メチル、エチル、n - プロピル、又は2 - メトキシエチルであ

50

る、実施形態 5 に記載の化合物。

【 0 0 4 6 】

実施形態 7 .  $R^1$  が、メチル又はエチルである、実施形態 6 に記載の化合物。

【 0 0 4 7 】

実施形態 8 .  $R^1$  が、メチルである、実施形態 6 に記載の化合物。

【 0 0 4 8 】

実施形態 9 .  $R^1$  が、H 以外である、実施形態 1 に記載の化合物。

【 0 0 4 9 】

実施形態 10 .  $R^1$  が、フェニル以外である、実施形態 1 に記載の化合物。

【 0 0 5 0 】

実施形態 11 . W が、O である、実施形態 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【 0 0 5 1 】

実施形態 12 . A が、A - 1、A - 4 及び A - 6 から選択される式 1 の化合物又は実施形態 1 ~ 11 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【 0 0 5 2 】

実施形態 13 . A が、A - 1 である、式 1 の化合物又は実施形態 12 に記載の化合物。

【 0 0 5 3 】

実施形態 14 . A が、A - 4 である、式 1 の化合物又は実施形態 12 に記載の化合物。

【 0 0 5 4 】

実施形態 15 . A が、A - 6 である、式 1 の化合物又は実施形態 12 に記載の化合物。

【 0 0 5 5 】

実施形態 16 . A が、A - 1 であり、 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$ 、 $X^4$ 、 $X^5$ 、 $X^6$ 、 $X^7$ 、 $X^8$  及び  $X^9$  が、それぞれ独立して  $CR^3$  である、式 1 の化合物又は実施形態 12 に記載の化合物。

【 0 0 5 6 】

実施形態 17 . A が、A - 1 であり、 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$ 、 $X^4$ 、 $X^5$ 、 $X^6$ 、 $X^7$ 、 $X^8$  及び  $X^9$  が、それぞれ CH である、式 1 の化合物又は実施形態 12 に記載の化合物。

【 0 0 5 7 】

実施形態 18 .  $R^2$  が、H、ハロゲン、シアノ、ホルミル、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_8$  アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 \sim C_8$  アルコキシカルボニルアルキル、 $C_2 \sim C_4$  アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_7$  アルキルカルボニルオキシ、 $C_4 \sim C_7$  アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$  アルケニル、 $C_3 \sim C_7$  アルキニル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$  ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$  シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$  ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_7$  ハロアルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$  ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$  アルコキシ、又は  $C_1 \sim C_5$  アルキルチオである、実施形態 1 ~ 17 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【 0 0 5 8 】

実施形態 19 .  $R^2$  が、H、ハロゲン、シアノ、ホルミル、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_2 \sim C_4$  アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_7$  アルキルカルボニルオキシ、 $C_4 \sim C_7$  アルキルシクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルアミノ、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$  シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$  ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_7$  ハロアルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキル、又は  $C_1 \sim C_7$  アルコキシである、実施形態 18 に記載の化合物。

【 0 0 5 9 】

10

20

30

40

50

実施形態 20 .  $R^2$  が、H、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_3 \sim C_5$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$  アルコキシアルキル、又は  $C_1 \sim C_3$  アルコキシである、実施形態 19 に記載の化合物。

【0060】

実施形態 21 .  $R^2$  が、H、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$  アルキル、シクロプロピル、 $C_1 \sim C_2$  ハロアルキル、メトキシ、又はエトキシである、実施形態 20 に記載の化合物。

【0061】

実施形態 22 .  $R^2$  が、H、Cl、Br、I、シアノ、メチル、又はメトキシである、実施形態 21 に記載の化合物。

10

【0062】

実施形態 23 .  $R^2$  が、H、Cl、メチル、又はメトキシである、実施形態 22 に記載の化合物。

【0063】

実施形態 24 .  $R^2$  が、Cl 又はメチルである、実施形態 23 に記載の化合物。

【0064】

実施形態 25 .  $R^2$  が、H 以外である、実施形態 1 ~ 23 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【0065】

実施形態 26 .  $R^2$  が、フェニル以外である、実施形態 1 ~ 17 のいずれか 1 つに記載の化合物。

20

【0066】

実施形態 27 .  $R^2$  が、ハロゲン、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$  ジアルキルアミノ、又は  $C_3 \sim C_7$  シクロアルキルである、実施形態 18 に記載の化合物。

【0067】

実施形態 28 .  $R^2$  が、 $C_1 \sim C_4$  アルキルアミノ又は  $C_2 \sim C_8$  ジアルキルアミノである、実施形態 27 に記載の化合物。

【0068】

実施形態 29 . L が、直接結合である、式 1 の化合物又は実施形態 1 ~ 28 のいずれか 1 つに記載の化合物。

30

【0069】

実施形態 30 . L が、直接結合であり、かつ G が H、 $C(=O)R^5$ 、 $C(=S)R^5$ 、 $CO_2R^6$ 、 $C(=O)SR^6$ 、 $CONR^7R^8$ 、又は  $P(=O)R^9R^{10}$  であるか、あるいは、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_2 \sim C_4$  アルケニル、 $C_2 \sim C_4$  アルキニル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$  ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_4$  アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、又は  $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキルである、式 1 の化合物又は実施形態 1 ~ 28 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【0070】

実施形態 31 . G が、H、 $C(=O)R^5$ 、 $CO_2R^6$ 、 $CONR^7R^8$ 、又は  $P(=O)R^9R^{10}$  であり、あるいは、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_2 \sim C_4$  アルケニル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$  アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、又は  $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキルである、実施形態 30 に記載の化合物。

40

【0071】

実施形態 32 . G が、H、 $C(=O)R^5$ 、 $CO_2R^6$ 、又は  $P(=O)R^9R^{10}$  であるか、あるいは、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$  アルコキシアルキル、又は  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルである、実施形態 31 に記載の化合物。

【0072】

実施形態 33 . G が、H、 $C(=O)R^5$ 、又は  $CO_2R^6$  であるか、あるいは、C

50

$C_2 \sim C_4$  アルコキシアルキル、又は  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルである、実施形態 32 に記載の化合物。

【0073】

実施形態 34 . G が、H である、実施形態 33 に記載の化合物。

【0074】

実施形態 35 . G が、 $C(=O)R^5$  である、実施形態 33 に記載の化合物。

【0075】

実施形態 36 . G が、 $CO_2R^6$  である、実施形態 33 に記載の化合物。

【0076】

実施形態 37 . G が、 $C_2 \sim C_4$  アルコキシアルキルである、実施形態 33 に記載の化合物。 10

【0077】

実施形態 38 . G が、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルである、実施形態 33 に記載の化合物。

【0078】

実施形態 39 . L が、 $C_1 \sim C_2$  アルカンジイル又は  $C_2 \sim C_3$  アルケンジイルである、式 1 の化合物又は実施形態 1 ~ 28 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【0079】

実施形態 40 . L が、 $C_1 \sim C_2$  アルカンジイルである、実施形態 39 に記載の化合物。 20

【0080】

実施形態 41 . L が、 $C_2 \sim C_3$  アルケンジイルである、実施形態 39 に記載の化合物。

【0081】

実施形態 42 . L が、 $-CH_2-$  又は  $-CH=CH-$  である、実施形態 39 に記載の化合物。

【0082】

実施形態 43 . L が、 $-CH_2-$  である、実施形態 42 に記載の化合物。

【0083】

実施形態 44 . 各  $R^3$  が、独立して、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$  アルキル、 $C_3 \sim C_4$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキル、又は  $C_1 \sim C_3$  アルコキシである、式 1 の化合物又は実施形態 1 ~ 43 のいずれか 1 つに記載の化合物。 30

【0084】

実施形態 45 . 各  $R^3$  が、独立して、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$  アルキル、シクロプロピル、又は  $C_1 \sim C_2$  ハロアルキルである、実施形態 44 に記載の化合物。

【0085】

実施形態 46 . 各  $R^3$  が、独立して、H、ハロゲン、メチル、エチル、又は  $CF_3$  である、実施形態 45 に記載の化合物。

【0086】

実施形態 47 . 各  $R^3$  が、独立して、H、F、Cl、Br、又はメチルである、実施形態 46 に記載の化合物。 40

【0087】

実施形態 48 . 各  $R^3$  が、H である、実施形態 47 に記載の化合物。

【0088】

上記実施形態 1 ~ 48 並びに本明細書に記載される任意の他の実施形態を含む本発明の実施形態は、任意の方法で組み合わせることができ、実施形態における変数の説明は、式 1 の化合物のみならず、式 1 の化合物を調製するのに有用な出発化合物及び中間化合物にも関する。加えて、上記の実施形態 1 ~ 48 並びに本明細書に記載される任意の他の実施形態、及びこれらの任意の組み合わせを含む本発明の実施形態は、本発明の組成物及び方法に関する。 50

## 【 0 0 8 9 】

実施形態 A . 式 1 の化合物、その N - オキシド及び塩、それらを含む組成物、並びに望ましくない植物を防除するためのそれらの使用方法であって、

R<sup>1</sup> が、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルカルボニルアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシカルボニルアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキルシクロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> シアノアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ニトロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルコキシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキルチオアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシ、ベンジル又はフェニルであり、

W が、O であり、

A が、A - 1、A - 4 及び A - 6 から選択され、

L が、直接結合であり、

G が、H、C(=O)R<sup>5</sup>、C(=S)R<sup>5</sup>、CO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、C(=O)SR<sup>6</sup>、CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、又は P(=O)R<sup>9</sup>R<sup>10</sup> であるか、あるいは、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルコキシアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、又は C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキルであり、

R<sup>2</sup> が、H、ハロゲン、シアノ、ホルミル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルカルボニルアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシカルボニルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキルカルボニルオキシ、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキルシクロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルアミノ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ジアルキルアミノ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> シアノアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ニトロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルコキシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシ、又は C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルキルチオであり、

各 R<sup>3</sup> が、独立して、H、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>4</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> ハロアルキル、又は C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコキシである、化合物。

## 【 0 0 9 0 】

実施形態 B . R<sup>1</sup> が、

H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシカルボニルアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキルシクロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> シアノアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ニトロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルコキシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキルチオアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシ、又はベンジルであり、

A が、A - 1 であり、

G が、H、C(=O)R<sup>5</sup>、CO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、又は P(=O)R<sup>9</sup>R<sup>10</sup> であるか、あるいは、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルケニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルコキシアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、又は C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキルであり、

R<sup>2</sup> が、H、ハロゲン、シアノ、ホルミル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキルカルボニルオキシ、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキルシクロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルアミノ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> シアノアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ニトロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルコキシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシアルキル、又は C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシであり、

各 R<sup>3</sup> が、独立して、H、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> アルキル、シクロプロピル、又は C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> ハロアルキルである、実施形態 A に記載の化合物。

10

20

30

40

50

## 【 0 0 9 1 】

実施形態 C .  $R^1$  が、

$C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_3 \sim C_4$  シクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$  シアノアルキル、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキル、又は  $C_2 \sim C_4$  アルコキシアルキルであり、

$G$  が、 $H$ 、 $C(=O)R^5$ 、 $CO_2R^6$ 、又は  $P(=O)R^9R^{10}$  であるか、あるいは、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$  アルコキシアルキル、又は  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルであり、

$R^2$  が、 $H$ 、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_3 \sim C_5$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$  アルコキシアルキル、又は  $C_1 \sim C_3$  アルコキシであり、

各  $R^3$  が、独立して、 $H$ 、ハロゲン、メチル、エチル、又は  $CF_3$  である、実施形態 B に記載の化合物。

## 【 0 0 9 2 】

実施形態 D .  $R^1$  が、

メチル、エチル、 $n$ -プロピル、又は 2-メトキシエチルであり、

$G$  が、 $H$ 、 $C(=O)R^5$ 、又は  $CO_2R^6$  であるか、あるいは、 $C_2 \sim C_4$  アルコキシアルキル、又は  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルであり、

$R^2$  が、 $H$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $-CN$ 、メチル、又はメトキシであり、

各  $R^3$  が、独立して、 $H$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、又はメチルである、実施形態 C に記載の化合物。

## 【 0 0 9 3 】

特定の実施形態は、

4 - ( 9 - アントラセニル ) - 6 - クロロ - 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 ( 2 H ) - ピリダジノン ( 化合物 1 )、

6 - クロロ - 4 - ( 10 - クロロ - 9 - アントラセニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 ( 2 H ) - ピリダジノン ( 化合物 2 )、及び

4 - ( 10 - ブロモ - 9 - アントラセニル ) - 6 - クロロ - 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 ( 2 H ) - ピリダジノン ( 化合物 3 ) からなる群から選択される、式 1 の化合物を含む。

## 【 0 0 9 4 】

本発明はまた、植生の場所 ( locus ) に、除草性有効量の本発明の化合物 ( 例えば、本明細書に記載の組成物として ) を適用させることを含む、望ましくない植生を防除する方法に関する。使用方法に関する注目すべき実施形態は、上記の実施形態の化合物を含むものである。本発明の化合物は、小麦、大麦、トウモロコシ、大豆、ヒマワリ、綿、アブラナ及びコメなどの作物、並びにサトウキビ、柑橘、果実及び堅果作物などの特殊作物における雑草の選択的防除に特に有用である。

## 【 0 0 9 5 】

また、実施形態が、上記の実施形態の化合物を含む本発明の除草組成物であることも注目すべきである。

## 【 0 0 9 6 】

本発明はまた、( a ) 式 1 から選択される化合物、その  $N$ -オキシド、及び塩と、( b ) ( b 1 ) 光化学系 I 阻害剤、( b 2 ) アセトヒドロキシ酸シンターゼ ( A H A S ) 阻害剤、( b 3 ) アセチル -  $CoA$  カルボキシラーゼ ( A C C a s e ) 阻害剤、( b 4 ) オーキシン模倣体 ( auxin mimic )、( b 5 ) 5 - エノール - ピルビンシキミ酸 - 3 - リン酸 ( E P S P ) シンターゼ阻害剤、( b 6 ) 光化学系 I 電子ダイバータ ( photosystem I electron diverter )、( b 7 ) プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼ ( P P O ) 阻害剤、( b 8 ) グルタミンシンターゼ ( G S ) 阻害剤、( b 9 ) 超長鎖脂肪酸 ( V L C F A ) エロンガーゼ阻害剤、( b 10 ) オーキシン輸送阻害剤、( b 11 ) フィトエンデサチュラーゼ ( P D S ) 阻害剤、( b 12 ) 4 - ヒドロキシフェニル - ピルビン酸ジオキシゲナーゼ ( H P P D ) 阻害剤、( b 13 ) ホモゲンチジン酸ソラネシルトランスフェラ

10

20

30

40

50



ーゼ (HST) 阻害剤、(b 1 4) セルロース生合成阻害剤、(b 1 5) 有糸分裂攪乱物質 (mitotic disruptor)、有機ヒ素剤、アシュラム、プロモブチド、シンメチリン (cin methylin)、クミルロン、ダゾメット、ジフェンゾコート (difenzoquat)、ダイムロン、エトベンザニド、フルレノール、ホサミン、ホサミン - アンモニウム、ヒダントシジン (hydantocidin)、メタム (metam)、メチルダイムロン (methyldymron)、オレイン酸、オキサジクロメホン (oxaziclomefone)、ペラルゴン酸 (pelargonic acid) 及びピリブチカルブ (pyributicarb) を含む他の除草剤、及び、(b 1 6) 除草剤毒性緩和剤 (herbicide safener) ; 並びに、(b 1) ~ (b 1 6) の化合物の塩から選択される少なくとも 1 つの追加の有効成分と、を含む除草剤混合物を含む。

【 0 0 9 7 】

「光化学系 I I 阻害剤」(b 1) は、 $Q_B$  - 結合ニッチ (binding niche) で D - 1 タンパク質に結合し、これにより、葉緑体チラコイド膜における  $Q_A$  から  $Q_B$  への電子伝達をブロックする化学化合物である。光化学系 I I を通過することによってブロックされた電子は、一連の反応を介して輸送されて、細胞膜を破壊して、葉緑体の膨潤、膜の漏れ、最終的に細胞破壊をもたらす有毒化合物を形成する。 $Q_B$  結合ニッチは 3 つの異なる結合部位を有し：結合部位 A は、アトラジンなどのトリアジン、ヘキサジノンなどのトリアジノン、プロマシルなどのウラシルに結合し、結合部位 B は、ジウロンなどのフェニル尿素に結合し、そして、結合部位 C は、ベンタゾンなどのベンゾチアジアゾール、プロモキシニルなどのニトリル、ピリデートなどのフェニル - ピリダジンに結合する。光化学系 I I 阻害剤の例としては、アメトリン、アミノカルバゾン、アトラジン、ベンタゾン、プロマシル、プロモフェノキシム (bromofenoxim)、プロモキシニル、クロルプロムロン (chlorbromuron)、クロリダゾン、クロロトルロン、クロロクスロン (chloroxuron)、クミルロン、シアナジン、ダイムロン、デスメディファム、デスメトリン、ジメフロノ、ジメタトリン、ジウロン、エチジムロン (ethidimuron)、フェヌロン、フルオメツロン、ヘキサジノン、アイオキシニル、イソプロツロン、イソウロン、レナシル、リニユロン、メタミトロン、メタベンズチアズロン、メトプロムロン、メトキスロン (metoxuron)、メトリブジン、モノリニユロン (monolinuron)、ネブロン、ペンタノクロル (pentanochlor)、フェンメディファム、プロメトン、プロメトリン、プロパニル、プロパジン、ピリダホル (pyridafol)、ピリデート、シデュロン、シマジン、シメトリン、テブチウロン、ターバシル (terbacil)、テルブメトン、テルブチラジン (terbuthylazine)、テルブトリン、及びトリエタジンが挙げられる。

【 0 0 9 8 】

「A H A S 阻害剤」(b 2) は、アセト乳酸シンターゼ (ALS) としても知られるアセトヒドロキシ酸シンターゼ (A H A S) を阻害し、これにより、タンパク質合成、並びに細胞の成長 (cell growth) に必要とされるバリン、ロイシン及びイソロイシンなどの分枝鎖脂肪酸族アミノ酸の産生を阻害して植物を死滅させる化学化合物である。A H A S 阻害剤の例としては、アミドスルフロン、アジムスルフロン、ベンスルフロン - メチル、ビスピリバック - ナトリウム、クロランスラム - メチル、クロリムロン - エチル、クロルスルフロン、シノスルフロン、シクロスルファムロン、ジクロスラム、エタメットフロノ - メチル (ethametsulfuron-methyl)、エトキシスルフロン、フラザスルフロン、フロラスラム、フルカルバゾン - ナトリウム、フルメツラム、フルピルスルフロン - メチル、フルピルスルフロン - ナトリウム、ホラムスルフロン、ハロスルフロン - メチル、イマザメタベンズ - メチル (imazamethabenz-methyl)、イマザモックス、イマザピック、イマザピル、イマザキン、イマゼタピル、イマゾスルフロン、ヨードスルフロン - メチル (ナトリウム塩を含む)、イオフェンスルフロン (2 - ヨード - N - [ [ (4 - メトキシ - 6 - メチル - 1, 3, 5 - トリアジン - 2 - イル) アミノ ] カルボニル ] ベンゼンスルホンアミド)、メソスルフロン - メチル、メタゾスルフロン (3 - クロロ - 4 - (5, 6 - ジヒドロ - 5 - メチル - 1, 4, 2 - ジオキサジン - 3 - イル) - N - [ [ (4, 6 - ジメトキシ - 2 - ピリミジニル) アミノ ] カルボニル ] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - スルホンアミド)、メトスラム、メトスルフロン - メチル、ニコスルフロン、オキサスル

10

20

30

40

50

フロン、ペノキスラム、プリミスルフロン - メチル (primisulfuron-methyl)、プロボキシカルバゾン - ナトリウム、プロピリスルフロン (2 - クロロ - N - [ [ (4, 6 - ジメトキシ - 2 - ピリミジニル) アミノ ] カルボニル ] - 6 - プロピルイミダゾ [ 1, 2 - b ] ピリダジン - 3 - スルホンアミド)、プロスルフロン、ピラゾスルフロン - エチル (pyrazosulfuron-ethyl)、ピリベンゾキシム、ピリフタリド、ピリミノバック - メチル、ピリチオバック - ナトリウム、リムスルフロン、スルホメツロン - メチル、スルホスルフロン、チエンカルバゾン、チフェンスルフロン - メチル (thifensulfuron-methyl)、トリアファモネ (N - [ 2 - [ (4, 6 - ジメトキシ - 1, 3, 5 - トリアジン - 2 - イル) カルボニル ] - 6 - フルオロフェニル ] - 1, 1 - ジフルオロ - N - メチルメタンスルホンアミド)、トリアスルフロン、トリベニユロン - メチル (tribenuron-methyl)、トリフロキシスルフロン (ナトリウム塩を含む)、トリフルスルフロン - メチル及びトリトスルフロンが挙げられる。

10

#### 【 0 0 9 9 】

「A C C a s e 阻害剤」(b 3) は、植物における脂質及び脂肪酸合成の早期段階の触媒を担うアセチル - C o A カルボキシラーゼ酵素を阻害する化学化合物である。脂質は細胞膜の必須の構成成分であり、これらを伴わずに新しい細胞を生産することは不可能である。アセチル C o A カルボキシラーゼの阻害及びその後の脂質産生の不足によって、特に、分裂組織などの活発な成長領域における細胞膜の完全性が損なわれることとなる。最終的に、シュート及び根茎の成長が止まり、シュート分裂組織 (shoot meristem) 及び根茎の芽が枯れ始まる。A C C a s e 阻害剤の例としては、アロキシジム、ブトロキシジム、クレトジム、クロジナホップ、シクロキシジム、シハロホップ、ジクロホップ、フェノキサプロップ、フルアジホップ、ハロキシホップ、ピノキサデン、プロホキシジム (prof oxydim)、プロパキサホップ、キサロホップ、セトキシジム、テブラロキシジム及びトラルコキシジムが挙げられ、フェノキサプロップ - P、フルアジホップ - P、ハロキシホップ - P 及びキサロホップ - P などの分割形態、並びにクロジナホップ - プロパルギル、シハロホップ - ブチル (cyhalofop-butyl)、ジクロホップ - メチル及びフェノキサプロップ - P - エチルなどのエステル形態が含まれる。

20

#### 【 0 1 0 0 】

オーキシンは、多くの植物組織における成長を調節する植物ホルモンである。「オーキシシン模倣体」(b 4) は、植物成長ホルモンのオーキシシンを模倣し、これにより、制御不可能かつ混乱した成長 (uncontrolled and disorganized growth) を引き起こし、感受性の強い種における植物死 (plant death) に至らせる化学化合物である。オーキシシン模倣体の例としては、アミノシクロピラクロル (6 - アミノ - 5 - クロロ - 2 - シクロプロピル - 4 - ピリミジンカルボン酸) 及びそのメチル、並びに、エチルエステル並びにそのナトリウム及びカリウム塩、アミノピラリド、ペナゾリン - エチル、クロラムベン、クラシホス (clacyfos)、クロメプロップ、クロピラリド、ジカンバ、2, 4 - D、2, 4 - D B、ジクロルプロップ、フルロキシピル、ハラウキシフェン (4 - アミノ - 3 - クロロ - 6 - (4 - クロロ - 2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) - 2 - ピリジンカルボン酸)、ハラウキシフェン - メチル (メチル 4 - アミノ - 3 - クロロ - 6 - (4 - クロロ - 2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) - 2 - ピリジンカルボキシレート)、M C P A、M C P B、メコプロップ、ピクロラム、キンクロラック、キンメラック、2, 3, 6 - T B A、トリクロピル、及びメチル 4 - アミノ - 3 - クロロ - 6 - (4 - クロロ - 2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) - 5 - フルオロ - 2 - ピリジンカルボキシレート (methyl 4 - amino-3-chloro-6-(4-chloro-2-fluoro-3-methoxyphenyl)-5-fluoro-2-pyridinecarboxylate) が挙げられる。

30

40

#### 【 0 1 0 1 】

「E P S P シンターゼ阻害剤」(b 5) は、チロシン、トリプトファン及びフェニルアラニンなどの芳香族アミノ酸の合成に関与する酵素である 5 - エノール - ピルビルシキミ酸 - 3 - リン酸シンターゼを阻害する化学化合物である。E P S P 阻害剤除草剤は植物群葉を介してすぐに吸収され、師部で成長点に移動する。グリホサートは、この群に属す

50

る比較的非選択的な発芽後除草剤である。グリホサートとしては、アンモニウム、イソプロピルアンモニウム、カリウム、ナトリウム（セスキナトリウム塩を含む）及びトリメシウム塩（代替名：スルホサート（sulfosate））などのエステル及び塩が挙げられる。

#### 【 0 1 0 2 】

「光化学系Ⅰ電子ダイバータ」（b 6）は、光化学系Ⅰから電子を受け取り、数々のサイクルの後にヒドロキシルラジカルを生成する化学化合物である。これらのラジカルは極めて高い反応性であり、膜脂肪酸及びクロロフィルを含む不飽和脂質を容易に破壊する。これにより細胞膜の完全性が破壊され、したがって、細胞及び細胞小器官に「漏れ（leak）」を生じさせ、葉が急速にしおれ、乾燥することとなり、最終的に、植物死に至る。この第2のタイプの光合成阻害剤の例としては、ジクワット（diquat）及びパラクアット（paraquat）が挙げられる。

10

#### 【 0 1 0 3 】

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

20

#### 【 0 1 0 4 】

「GS阻害剤」（b 8）は、植物がアンモニアをグルタミンへの転換に用いるグルタミンシンテターゼ酵素の活性を阻害する化学化合物である。したがって、アンモニアが蓄積し、グルタミンレベルが低下する。植物損傷は、おそらくは、アンモニアの毒性と他の代謝プロセスに必要とされるアミノ酸の欠乏との複合効果により生じる。GS阻害剤としては、グルホシネート・アンモニウム及び他のホスフィノトリシン誘導体、グルホシネート・P（（2S）-2-アミノ-4-（ヒドロキシメチルホスフィニル）ブタン酸）及びピラナホス（bilanaphos）などのグルホシネート及びそのエステル及び塩が挙げられる。

30

#### 【 0 1 0 5 】

「VLCAエロンガーゼ阻害剤」（b 9）は、エロンガーゼを阻害する広く多様な化学構造を有する除草剤である。エロンガーゼは、VLCAの生合成に關与する葉緑体中又はその付近に位置する酵素の1種である。植物中において、超長鎖脂肪酸は、葉面における乾燥を防止し、花粉粒に安定性をもたらす疎水性ポリマーの主な構成成分である。このような除草剤としては、アセトクロール、アラクロール、アニロホス、ブタクロール、カフェンストロール、ジメタクロール、ジメテナミド、ジフェナミド（diphenamid）、フェノキサスルホン（3 - [ [ ( 2, 5 - ジクロロ - 4 - エトキシフェニル ) メチル ] スルホニル ] - 4, 5 - ジヒドロ - 5, 5 - ジメチルイソキサゾール）、フェントラザミド、フルフェナセット、インダノファン、メフェナセット、メタザクロール、メトラクロール、ナプロアニリド、ナプロパミド、ナプロパミド・M（（2R）-N, N - ジエチル - 2 - ( 1 - ナフタレニルオキシ ) プロパンアミド）、ペトキサミド、ピペロホス、プレチラクロール、プロパクロール、プロピソクロール（propisochlor）、ピロキサスルホン、及びテニルクロール（thenylchlor）が挙げられ、S - メトラクロール及びクロロアセタ

40

50

ミド及びオキシアセタミドなどの分割形態が含まれる。

【 0 1 0 6 】

「オーキシン輸送阻害剤」(b 1 0)は、オーキシン - 担体タンパク質と結合することなどにより植物中におけるオーキシン輸送を阻害する化学物質である。オーキシン輸送阻害剤の例としては、ジフルフェンゾピル、ナブタラム(N - (1 - ナフチル) - フタルアミド酸及び2 - [(1 - ナフタレニルアミノ)カルボニル]安息香酸としても知られている)が挙げられる。

【 0 1 0 7 】

「PDS阻害剤」(b 1 1)は、フィトエンデサチュラーゼステップにおけるカロチノイド合成経路を阻害する化学化合物である。PDS阻害剤の例としては、ベフルブタミド、ジフルヘニカン、フルリドン、フルクロリドン(flurochloridone)、フルルタモンノルフルルゾン(flurtamone norflurzon)及びピコリナフェンが挙げられる。

10

【 0 1 0 8 】

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

20

30

【 0 1 0 9 】

「HST阻害剤」(b 1 3)は、植物がホモゲンチジン酸を2 - メチル - 6 - ソラニル - 1 , 4 - ベンゾキノンに転換する能力を破壊し、これにより、カロチノイド生合成を破壊する。HST阻害剤の例としては、シクロピリモルト(6 - クロロ - 3 - (2 - シクロプロピル - 6 - メチルフェノキシ) - 4 - ピリダジニル4 - モルホリノカルボキシレート)(cyclopyrimorate (6-chloro-3-(2-cyclopropyl-6-methylphenoxy)-4-pyridazinyl 4-morpholinecarboxylate))、ハロキシジン、ピリクロール、3 - (2 - クロロ - 3 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 1 , 5 - ナフチリジン - 2 (1 H) - オン、7 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 5 - (2 , 2 - ジフルオロエチル) - 8 - ヒドロキシピリド[2 , 3 - b]ピラジン - 6 (5 H) - オン及び4 - (2 , 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノンが挙げられる。

40

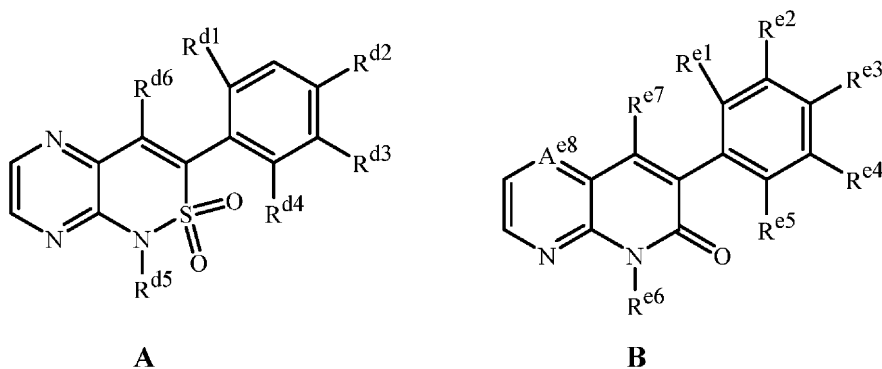
【 0 1 1 0 】

HST阻害剤はまた、式A及びBの化合物が挙げられる。

50

【 0 1 1 1 】

【 化 7 】



10

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

20

【 0 1 1 2 】

セルロース生合成阻害剤 (b14) は、ある植物におけるセルロースの生合成を阻害する。これらは、幼植物 (young plant) 又は急速に成長する植物に対して発芽前適用、又は、発芽後早期に適用された場合に最も効果的である。セルロース生合成阻害剤の例としては、クロルチアミド、ジクロベニル、フルボキサム、インダジフラム ( $N^2$ -[(1R, 2S)-2, 3-ジヒドロ-2, 6-ジメチル-1H-インデン-1-イル]-6-(1-フルオロエチル)-1, 3, 5-トリアジン-2, 4-ジアミン)、イソキサベン及びトリアジフラムが挙げられる。

【 0 1 1 3 】

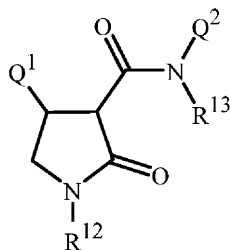
30

「他の除草剤」(b15) は、有糸分裂攪乱物質 (例えば、フラムプロップ-M-メチル (flamprop-M-methyl) 及びフラムプロップ-M-イソプロピル (flamprop-M-isopropyl))、有機ヒ素剤 (例えば、DSMA 及び MSMA)、7, 8-ジヒドロプテロイン酸シンターゼ阻害剤、葉緑体イソプレノイド合成阻害剤及び細胞壁生合成阻害剤などの多様に異なる作用形態を介して作用する除草剤を含む。他の除草剤は、未知の作用形態を有するか、又は、(b1) ~ (b14) に列挙された特定のカテゴリーのいずれにも属さないか、又は、上記に列挙した作用形態の組み合わせを介して作用する除草剤を含む。他の除草剤の例としては、アクロニフェン、アシュラム、アミトロール、プロモブチド、シンメチリン、クロマゾン、クミルロン、ダイムロン、ジフェンゾコート、エトベンザニド、フルオメツロン、フルレノール、ホサミン、ホサミン-アンモニウム、ダゾメット、ダイムロン、イブフェンカルバゾン (1-(2, 4-ジクロロフェニル)-N-(2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 5-ジヒドロ-N-(1-メチルエチル)-5-オキソ-4H-1, 2, 4-トリアゾール-4-カルボキサミド)、メタム、メチルダイムロン、オレイン酸、オキサジクロメホン、ペラルゴン酸、ピリブチカルブ、及び 5-[[[(2, 6-ジフルオロフェニル)メトキシ]メチル]-4, 5-ジヒドロ-5-メチル-3-(3-メチル-2-チエニル)イソキサゾール]が挙げられる。「他の除草剤」(b15) はまた、式 (b15A) の化合物を含む。

40

【 0 1 1 4 】

## 【化 8】



(b15A)

式中、

$R^{12}$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、又は  $C_4 \sim C_8$  シクロアルキルであり、

$R^{13}$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシであり、

$Q^1$  は、フェニル、チエニル、ピリジニル、ベンゾジオキソリル、ナフチル、ナフタレニル、ベンゾフラニル、フラニル、ベンゾチオフエニル、及びピラゾリルからなる群から選択される、任意に置換された環系であり、置換されたとき、当該環系は 1 ~ 3 個の  $R^{14}$  で置換されており、

$Q^2$  は、フェニル、ピリジニル、ベンゾジオキソリル、ピリジノニル、チアジアゾリル、チアゾリル、及びオキサゾリルからなる群から選択される、任意に置換された環系であり、置換されたとき、当該環系は 1 ~ 3 個の  $R^{15}$  で置換されており、

各  $R^{14}$  は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_8$  シアロアルキル (cycloalkyl)、シアノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルスルホニル、 $SF_5$ 、 $MHR^{17}$  であるか、あるいは 1 ~ 3 個の  $R^{16}$  で任意に置換されたフェニルであるか、あるいは 1 ~ 3 個の  $R^{16}$  で任意に置換されたピラゾリルであり、

各  $R^{15}$  は独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシ、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルスルホニルであり、

各  $R^{16}$  は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、又は  $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルであり、

$R^{17}$  は、 $C_1 \sim C_4$  アルコシカルボニルである。

## 【0115】

「他の除草剤」(b15) がまた、式 (b15A) の化合物を含む一実施形態では、 $R^{12}$  が、H、又は  $C_1 \sim C_6$  アルキルであることが好ましく、より好ましくは、 $R^{12}$  は、H、又はメチルである。好ましくは、 $R^{13}$  は、H である。好ましくは、 $Q^1$  は、フェニル環又はピリジニル環のいずれかであり、各環は 1 ~ 3 個の  $R^{14}$  で置換されており、より好ましくは、 $Q^1$  は、1 ~ 2 個の  $R^{14}$  で置換されたフェニル環である。好ましくは、 $Q^2$  は、1 ~ 3 個の  $R^{15}$  で置換されたフェニル環であり、より好ましくは、 $Q^2$  は、1 ~ 2 個の  $R^{15}$  で置換されたフェニル環である。好ましくは、各  $R^{14}$  は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$  アルコキシ、又は  $C_1 \sim C_3$  ハロアルコキシであり、より好ましくは、各  $R^{14}$  は、独立して、クロロ、フルオロ、ブromo、 $C_1 \sim C_2$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$  ハロアルコキシ、又は  $C_1 \sim C_2$  アルコキシである。好ましくは、各  $R^{15}$  は独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルコキシであり、より好ましくは、各  $R^{15}$  は、独立して、クロロ、フルオロ、ブromo、 $C_1 \sim C_2$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$  ハロアルコキシ、又は  $C_1 \sim C_2$  アルコキシである。「他の除草剤」(b15) として特に好ましいものは、以下の (b15A-1) ~ (b15A-15) のいずれか 1 つが挙げられる：

## 【0116】

10

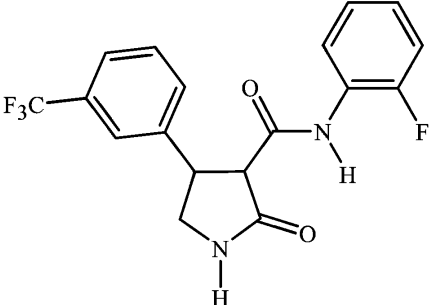
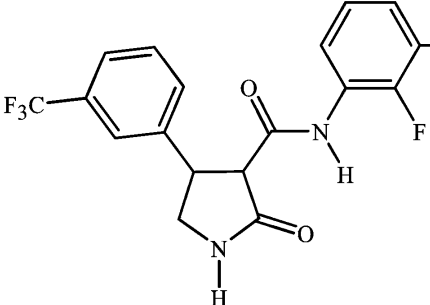
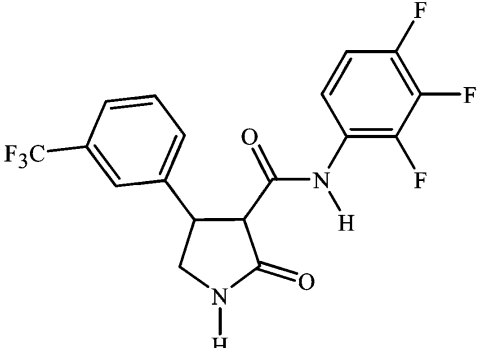
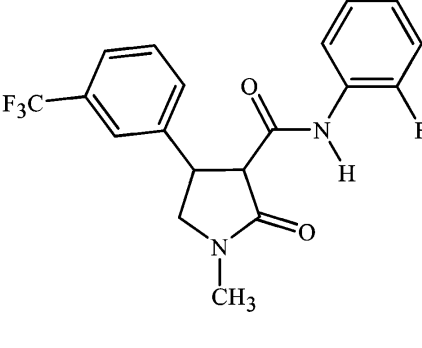
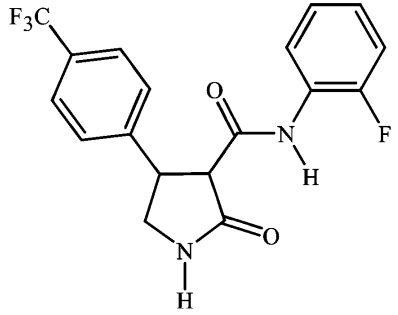
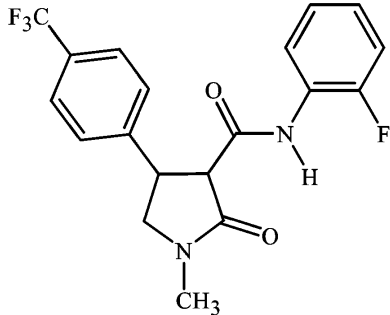
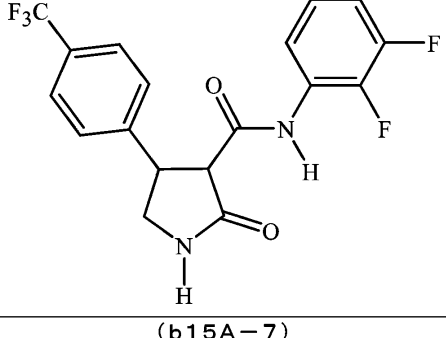
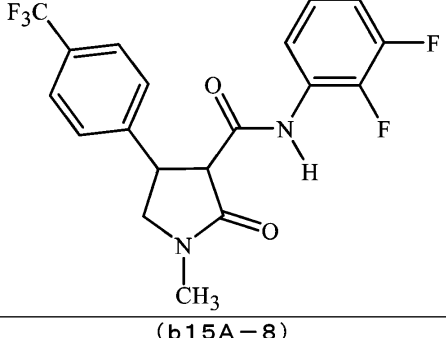
20

30

40

50

【表 1 - 1】

 <p>(b15A-1)</p>	 <p>(b15A-2)</p>
 <p>(b15A-3)</p>	 <p>(b15A-4)</p>
 <p>(b15A-5)</p>	 <p>(b15A-6)</p>
 <p>(b15A-7)</p>	 <p>(b15A-8)</p>

【 0 1 1 7 】

10

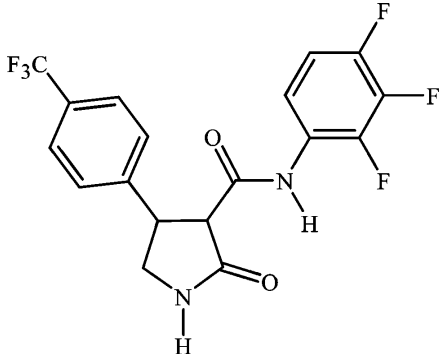
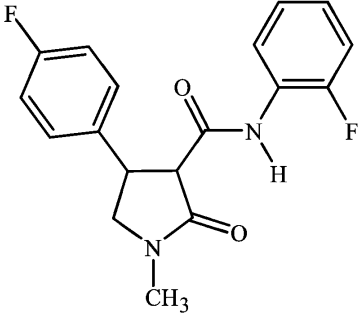
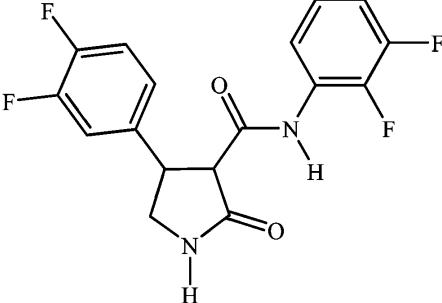
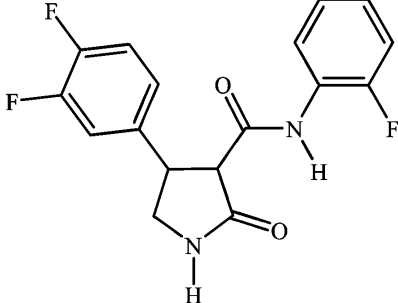
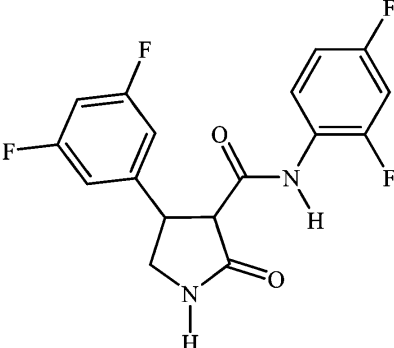
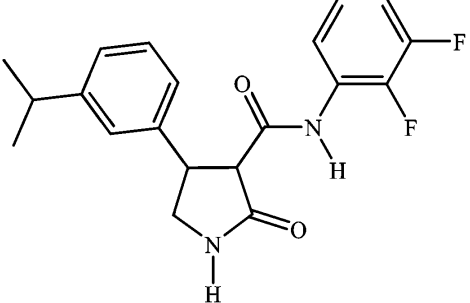
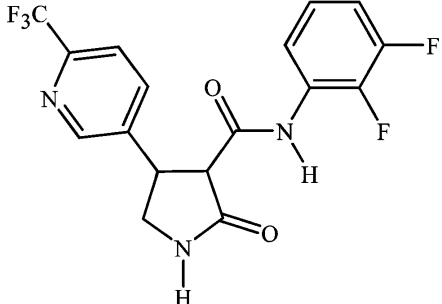
20

30

40

【表 1 - 2】

(上記表の続き)

 <p>(b15A-9)</p>	 <p>(b15A-10)</p>	10
 <p>(b15A-11)</p>	 <p>(b15A-12)</p>	20
 <p>(b15A-13)</p>	 <p>(b15A-14)</p>	30
 <p>(b15A-15)</p>	<p>。</p>	40

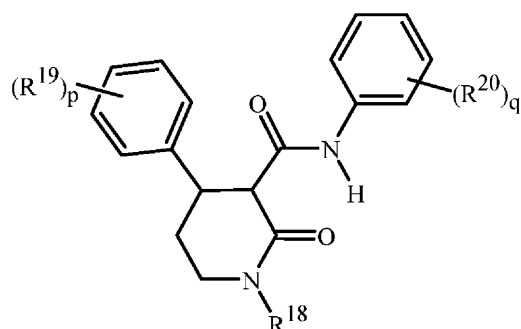
【 0 1 1 8 】

「他の除草剤」(b 1 5)はまた、式(b 1 5 B)の化合物を含む。

【 0 1 1 9 】



## 【化 9】



(b15B)

10

式中、

$R^{18}$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、又は  $C_4 \sim C_8$  シクロアルキルであり、

各  $R^{19}$  は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、又は  $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシであり、

$p$  は、0、1、2、又は3の整数であり、

各  $R^{20}$  は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、又は  $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシであり、

20

$q$  は、0、1、2、又は3の整数である。

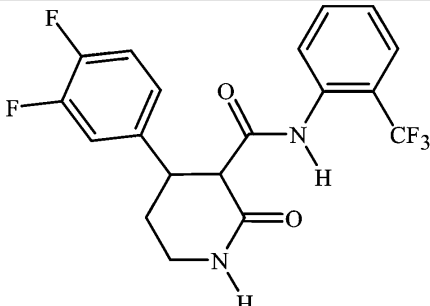
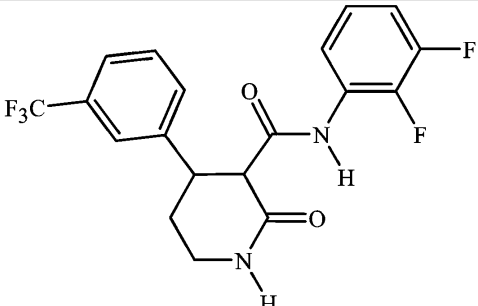
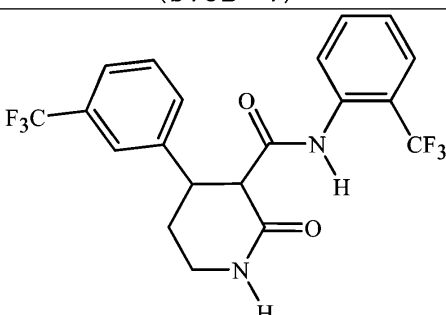
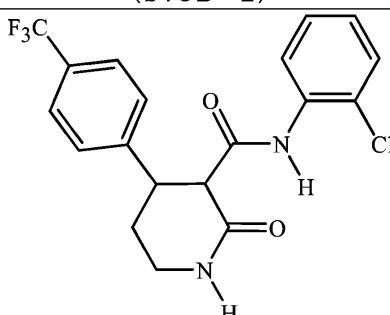
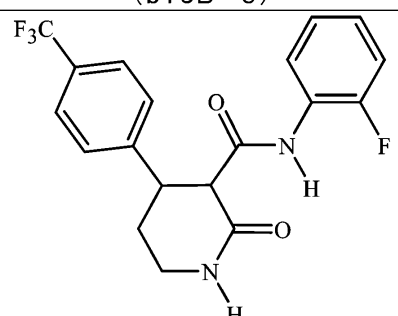
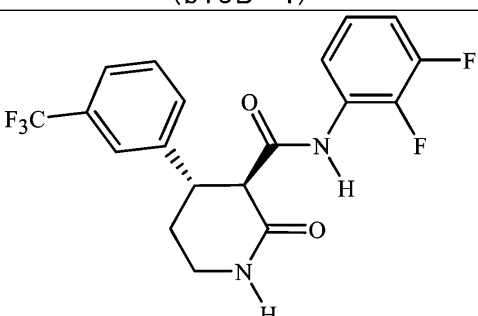
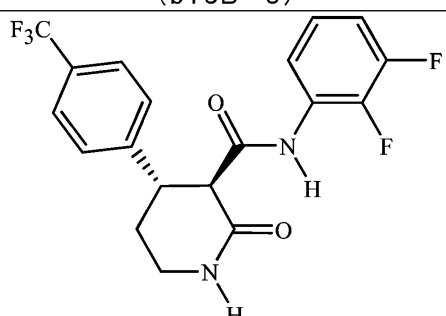
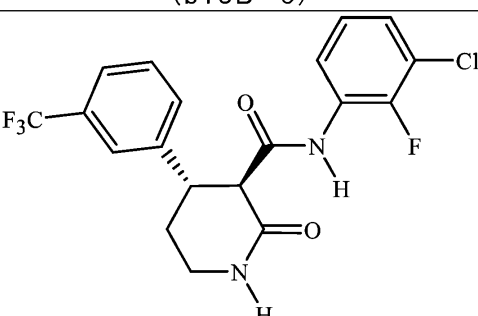
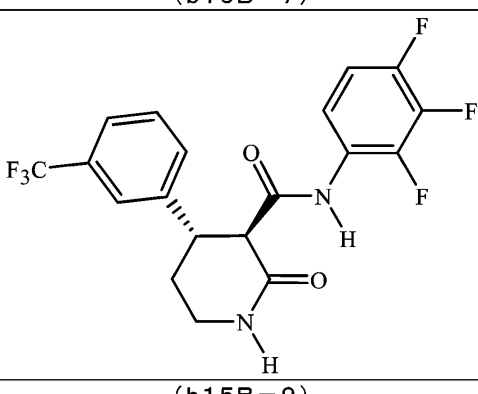
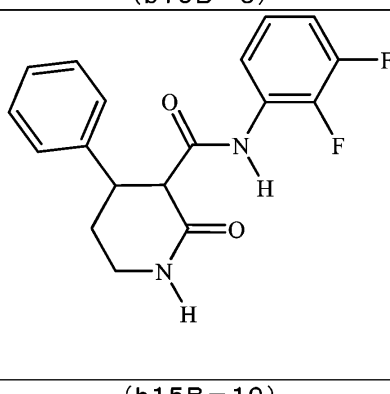
## 【0120】

「他の除草剤」(b15)はまた、式(b15B)の化合物を含む一実施形態では、 $R^{18}$  が、H、メチル、エチル、又はプロピルであることが好ましく、より好ましくは、 $R^{18}$  は、H、又はメチルであり、最も好ましくは、 $R^{18}$  はHである。好ましくは、各  $R^{19}$  は、独立して、クロロ、フルオロ、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキル、又は  $C_1 \sim C_3$  ハロアルコキシであり、より好ましくは、各  $R^{19}$  は、独立して、クロロ、フルオロ、 $C_1$  フルオロアルキル(すなわち、フルオロメチル、ジフルオロメチル、又はトリフルオロメチル)又は  $C_1$  フルオロアルコキシ(すなわち、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、又はフルオロメトキシ)である。好ましくは、各  $R^{20}$  は、独立して、クロロ、フルオロ、 $C_1$  ハロアルキル、又は  $C_1$  ハロアルコキシであり、より好ましくは、各  $R^{20}$  は、独立して、クロロ、フルオロ、 $C_1$  フルオロアルキル(すなわち、フルオロメチル、ジフルオロメチル、又はトリフルオロメチル)又は  $C_1$  フルオロアルコキシ(すなわち、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、又はフルオロメトキシ)である。「他の除草剤」(b15)として特に好ましいものは、以下の(b15B-1)~(b15B-19)のいずれか1つが挙げられる：

30

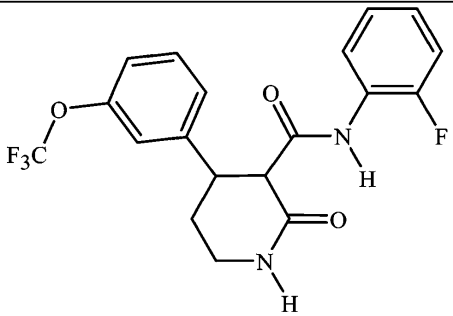
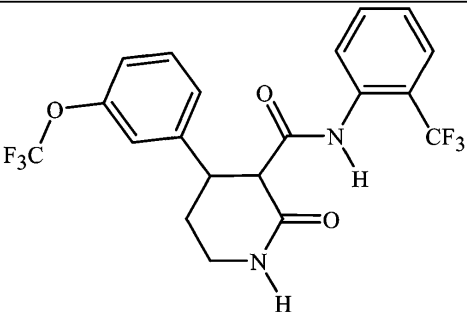
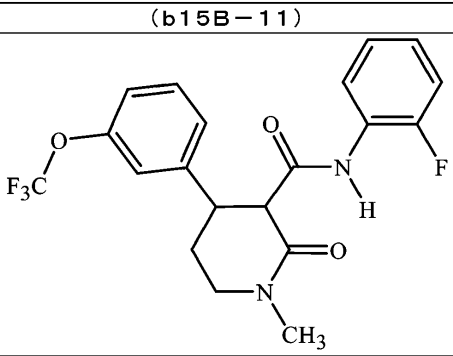
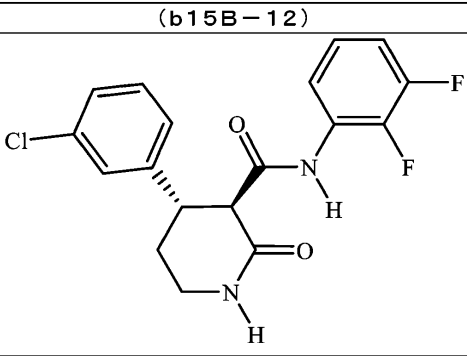
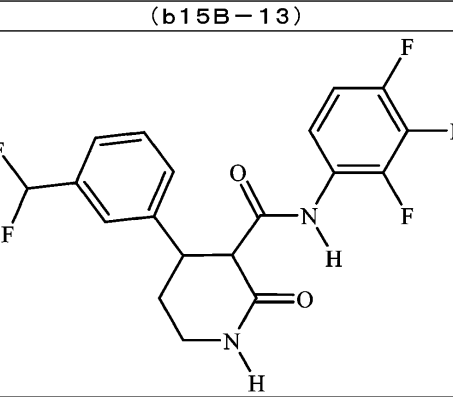
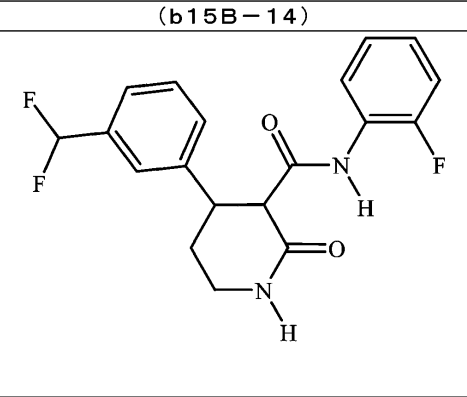
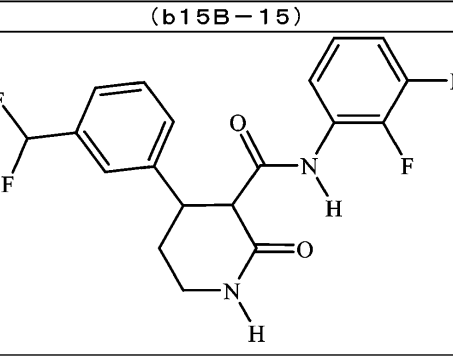
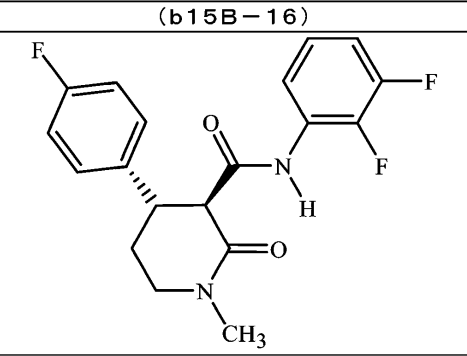
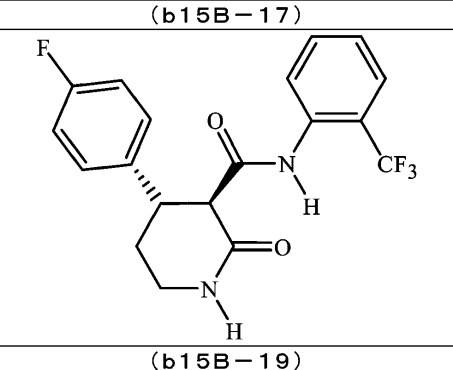
## 【0121】

【表 2 - 1】

		10
(b15B-1)	(b15B-2)	
		20
(b15B-3)	(b15B-4)	
		30
(b15B-5)	(b15B-6)	
		40
(b15B-7)	(b15B-8)	
		
(b15B-9)	(b15B-10)	

【表 2 - 2】

(上記表の続き)

 <p>(b15B-11)</p>	 <p>(b15B-12)</p>	10
 <p>(b15B-13)</p>	 <p>(b15B-14)</p>	20
 <p>(b15B-15)</p>	 <p>(b15B-16)</p>	30
 <p>(b15B-17)</p>	 <p>(b15B-18)</p>	40
 <p>(b15B-19)</p>	<p>。</p>	

「除草剤毒性緩和剤」(b16)は、ある作物に対する除草剤の植物毒性効果を排除又は低減するために除草剤配合物に加えられる物質である。これらの化合物は、除草剤による被害から作物を保護するが、典型的には、除草剤による望ましくない植生の防除を妨げないものである。除草剤毒性緩和剤の例としては、ベノキサコール(benoxacor)、クロキントセット-メキシル、クミルロン、シオメトリニル、シブロスルファミド、ダイムロン、ジクロロミド、ジシクロノン、ジエトレート、ジメピペレート(dimepiperate)、フェンクロラゾール-エチル、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン-エチル、メフェンピル-ジエチル、メフェネート、メトキシフェノン、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、N(アミノカルボニル)-2-メチルベンゼンスルホンアミド及びN-(アミノカルボニル)-2-フルオロベンゼンスルホンアミド、1-ブromo-4-[(クロロメチル)スルホニル]ベンゼン、2-(ジクロロメチル)-2-メチル-1,3-ジオキサラン(MG191)、4-(ジクロロアセチル)-1-オキサ-4-アゾスピロ[4.5]デカン(MON4660)、2,2-ジクロロ-1-(2,2,5-トリメチル-3-オキサゾリジニル)-エタノン及び2-メトキシ-N-[[4-[(メチルアミノ)カルボニル]アミノ]フェニル]スルホニル]-ベンズアミドが挙げられるが、これらに限定されない。

10

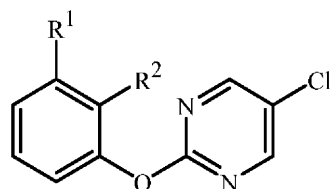
【0124】

別の実施形態では、「他の除草剤」(b15)がまた、式(b15C)の化合物を含み、

【0125】

20

【化10】



(b15C)

式中、 $R^1$ は、Cl、Br、又はCNであり、 $R^2$ は、 $C(=O)CH_2CH_2CF_3$ 、 $CH_2CH_2CH_2CH_2CF_3$ 、又は3-CHF<sub>2</sub>-イソオキサゾール-5-イルである。

30

【0126】

望ましくない植生のより良好な防除(例えば、相加的を上回る効果、より広範な範囲の雑草防除、又は強化された作物安全性などのより低い使用率)のためには、又は抵抗性雑草(resistant weed)の発生を防止するためには、本発明の化合物と、アトラジン、アジメスルフロン、ペフルブタミド、S-ペフルブタミド、ベンズイソチアゾリノン、カルフェントラゾン-エチル、クロリムロン-エチル、クロルスルフロン-メチル、クロマゾン、クロピラリドカリウム、クロランスラム-メチル、2-[(2,4-ジクロロフェニル)メチル]-4,4-ジメチル-イソオキサゾリジノン、2-[(2,5-ジクロロフェニル)メチル]-4,4-ジメチル-イソオキサゾリジノン、エタメットフロン-メチル、フルメツラム、4-(4-フルオロフェニル)-6-[(2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセン-1-イル)カルボニル]-2-メチル-1,2,4-トリアジン-3,5-(2H,4H)-ジオン、フルピルスルフロン-メチル、フルチアセット-メチル、ホメサフェン、イマゼタピル、レナシル、メソトリオン、メトリブジン、メトスルフロン-メチル、ペトキサミド、ピクロラム、ピロキサスルホン、キンクロラック、リムスルフロン、S-メトラクロール、スルフェントラゾン、チフェンスルフロン-メチル、トリフルスルフロン-メチル、及びトリベニユロン-メチルからなる群から選択される除草剤との混合物が好ましい。

40

【0127】

50

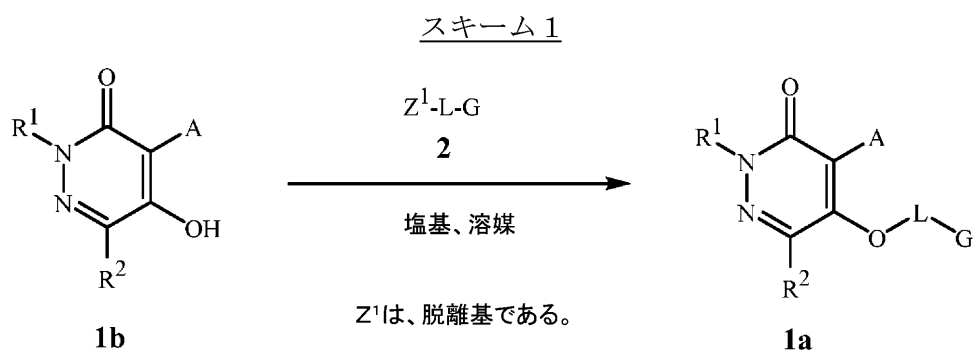
スキーム 1 ~ 16 に記載されている以下の方法、及び変形の 1 つ以上を用いて、式 1 の化合物を調製することができる。式 1 ~ 29 の化合物における  $R^1$ 、 $R^2$ 、W、A、L、及び G の定義は、別段の定めがない限り、発明の概要において上記に定義されたとおりである。式 1 a、1 b、及び 1 c は、式 1 の化合物のサブセットであり、式 1 a、1 b、及び 1 c に関する全ての置換基は、別段の定めがない限り、式 1 について上記に定義されたとおりである。

#### 【0128】

スキーム 1 に示されているとおり、式 1 a のピリダジノン（式 1 の化合物のサブセットであり、式中、W は O であり、L 及び G は上記に定義されているとおりであるが、L は直接結合以外であり、かつ G は水素以外である）は、式 1 b の置換 5 - ヒドロキシ - 3 (2 H) - ピリダジノン（すなわち、W が O であり、L は直接結合であり、G は H である式 1）と、式 2 の好適な求電子性試薬（すなわち、 $Z^1$  - L - G であり、式中、 $Z^1$  は、代替的に、核離基（nucleofuge）として知られている、ハロゲンなどの脱離基（leaving group）である）を塩基の存在下に、適切な溶媒中で反応させることにより形成することが可能である。式 2（式中、 $Z^1$  は Cl であり、L は直接結合である）を表す試薬クラスのいくつかの例としては、酸塩化物（G は - (C=O)  $R^5$ ）、クロロホルメート（G は - CO<sub>2</sub>  $R^6$ ）、塩化カルバモイル（G は - CONR<sup>7</sup>  $R^8$ ）、塩化スルホニル（G は - S(O)<sub>2</sub>  $R^5$ ）、及びクロロスルホンアミド（G は - S(O)<sub>2</sub> NR<sup>7</sup>  $R^8$ ）が挙げられる。この反応に好適な塩基の例としては、炭酸カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、又はカリウム *tert* - ブトキシドが挙げられるが、これらに限定されず、用いられる特定の塩基に応じて、適切な溶媒は、プロトン性又は非プロトン性であることが可能であり、無水又は水溶液混合物（aqueous mixture）として用いることが可能である。この反応に好ましい溶媒としては、アセトニトリル、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、1, 2 - ジメトキシエタン、ジオキサン、ジクロロメタン、又は N, N - ジメチルホルムアミドが挙げられる。この反応は、典型的には、0 から溶媒の還流温度までの範囲の温度で行うことができる。

#### 【0129】

#### 【化 11】



#### 【0130】

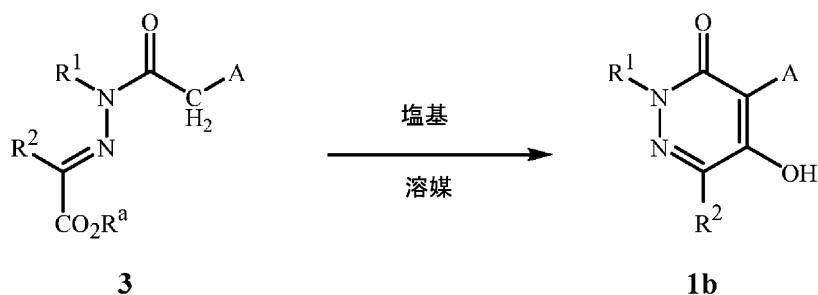
式 1 b の置換 5 - ヒドロキシ - 3 (2 H) - ピリダジノンは、スキーム 2 において概説されているとおり、塩基及び溶媒の存在下における式 3 のヒドラジドエステル（式中、 $R^a$  は、アルキル、典型的にはメチル又はエチルである）の環化によって調製することができる。この反応に好適な塩基としては、炭酸カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、カリウム *t* - ブトキシド、又は 1, 8 ジアザビシクロ [5.4.0] ウンデカ - 7 - エンが挙げられるが、これらに限定されない。使用される特定の塩基に応じて、適切な溶媒は、プロトン性又は非プロトン性であることができ、無水物又は水溶液混合物として使用することができる。この環化のための溶媒としては、アセトニトリル、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、1, 2 - ジメトキシエタン、ジクロロメタン、又は N, N - ジメチルホルムアミドが挙げられる。この環化のための温度は、一般に、0 から溶媒の還流温度の範囲である。式 C<sub>12</sub>H<sub>13</sub>(CO<sub>2</sub>C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)C=NNCH<sub>3</sub>C(=O)CH<sub>2</sub>Ar（式中、Ar は、式 3 に示

される二環系の代わりに置換フェニルである)のヒドラジドエステル中間体を、対応する 4 - アリール - 5 - ヒドロキシ - ピリダジノンに環化するための文献の方法は、米国特許第 8 , 5 4 1 , 4 1 4 号及び同第 8 , 4 7 0 , 7 3 8 号に開示されている。これらの特許に報告されているのと同じ条件が、式 3 のヒドラゾンエステルを式 1 b のピリダジノンに環化することに適用可能である。

【 0 1 3 1 】

【 化 1 2 】

スキーム 2



10

【 0 1 3 2 】

式 3 の置換ヒドラジドエステルは、スキーム 3 において概説されているとおり、式 4 のヒドラゾンエステル (式中、 $R^a$  はアルキルであり、典型的にはメチル又はエチルである) を、塩基及び溶媒の存在下で式 5 の酸塩化物とカップリングさせることによって調製することができる。この反応に好ましい塩基は、通常、トリエチルアミン又はヒューニッヒ塩基 (Hunig's base) などの第 3 級アミンであるが、N, N - ジメチルアミノピリジン、炭酸カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、又はカリウム t - ブトキシドを含む他の塩基を使用することもできる。使用される特定の塩基に応じて、適切な溶媒は、反応が無水条件下で、又はショットテン・バウマン条件 (Schotten-Baumann condition) 下で水溶液混合物として起こるプロトン性又は非プロトン性であり得る。窒素上でのこのアシル化に使用される溶媒としては、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、トルエン、1, 2 - ジメトキシエタン、ジクロロメタン、又は N, N - ジメチルホルムアミドが挙げられる。この反応のための温度は、0 から溶媒の還流温度の範囲であり得る。式  $\text{CH}_3(\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5)\text{C}=\text{NNCH}_3\text{C}(=\text{O})\text{Ar}$  (式中、Ar は置換フェニルである) の関連するヒドラジドエステル中間体の作製方法は、特許文献に公開されており、米国特許第 8 , 5 4 1 , 4 1 4 号及び同第 8 , 4 7 0 , 7 3 8 号、並びに米国特許出願公開第 2 0 1 0 / 0 2 6 7 5 6 1 号を参照されたい。これらの特許公報に開示される手順は、スキーム 3 に示されるように、本発明の化合物を調製するのに有用な中間体を作製するために直接適用可能である。

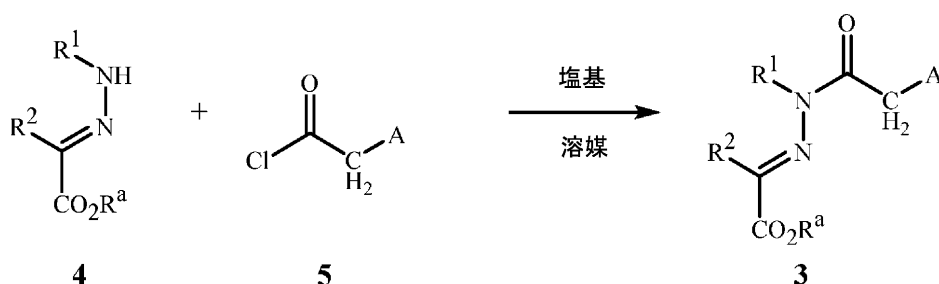
20

30

【 0 1 3 3 】

【 化 1 3 】

スキーム 3



40

【 0 1 3 4 】

式 4 のヒドラゾンエステルは、一般的に 0 ~ 8 0 の範囲の温度で、式  $R^1\text{NHNH}_2$  の適切に置換されたヒドラジンと、式  $R^2(\text{C}=\text{O})\text{CO}_2R^a$  (式中、 $R^a$  は、典型的にはメチル又はエチルである) のケトン又はアルデヒドエステルとの反応によって容易

50

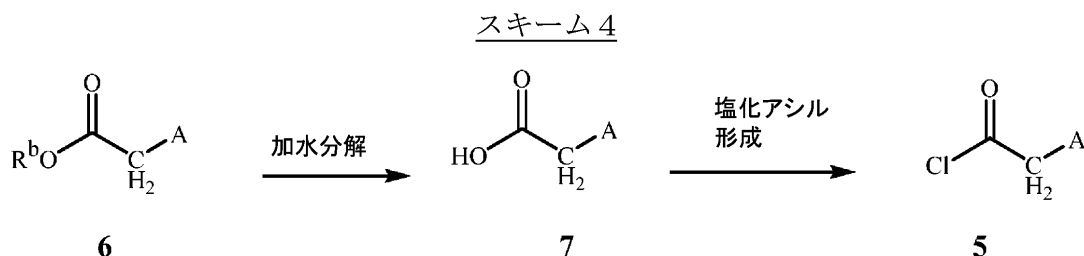
に入手可能である。米国特許出願公開第2007/0112038号及び同第2005/0256123号は、メチルヒドラジン及びケトエステル $\text{CH}_3(\text{C}=\text{O})\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$ からヒドラゾンを形成するための手順を開示している。

#### 【0135】

スキーム4に示すように、式5の塩化アセチルは、式6の対応する酢酸エステルから調製することができ、式中、 $\text{R}^b$ は、典型的には、エステル加水分解及び酸塩化物形成を介してのメチル又はエチルである。この変換についての標準的な方法は、文献において知られている。例えば、エステル加水分解は、式6のエステルのアルコール溶液をアルカリ金属水酸化物の水溶液と一緒に加熱し、続いて、鉱酸で酸性化することにより達成可能である。次いで、ジクロロメタンなどの不活性溶媒中における塩化オキサリル及び触媒量のN,N-ジメチルホルムアミドによる処理によって、形成された式7のカルボン酸を式5の対応する塩化アシルに転換可能である。J. Heterocyclic Chem. 1983, 20(6), 1697-1703; J. Med. Chem. 2007, 50(1), 40-64; 及びPCT特許公開第2005/012291号、国際公開第98/49141号並びに国際公開第98/49158号には、ベンゾフラン-及びベンゾチオフエン-酢酸エステルの対応する酢酸への加水分解が開示されている。Monatshefte fuer Chemie 1968, 99(2) 715-720、及び国際公開第2004046122号、国際公開第2009/038974号並びにJP09077767号には、ベンゾフラン-及びベンゾチオフエン-酢酸の対応する酸塩化物への転換が開示されている。

#### 【0136】

#### 【化14】



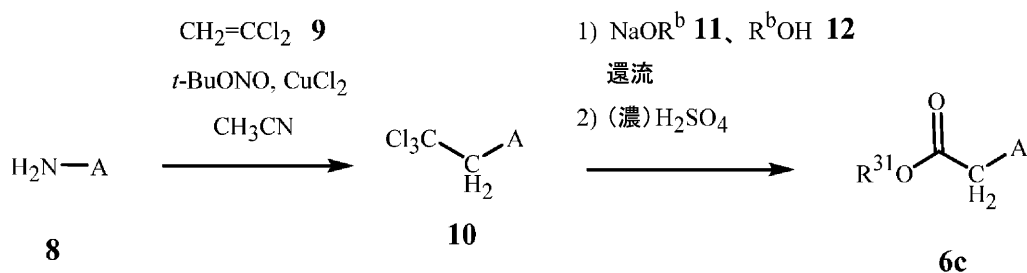
#### 【0137】

スキーム5に示すように、式6cのヘテロアリアル酢酸誘導体は、式8の適切に置換されたヘテロアリアルアミンから調製することができる。この方法によれば、式8のアミンは、1,1-ジクロロエテン(9)の存在下で、ジアゾ化され(好ましくは、アセトニトリル中、塩化銅の存在下でt-ブチルナイトライトを用いて)、式10の対応するトリクロロエチル複素環を得る。次いで、式10のトリクロロエチル複素環を、式12のアルコールなどの好適な溶媒中で式11のナトリウムアルコキシドなどの適切なアルカリ又はアルカリ土類アルコキシドと加熱し、続いて濃硫酸などを用いて酸性化して、式6cの複素環式酢酸エステル(heterocyclic acetic acid ester)を得る。この方法は、Pest. Manag. Sci. 2011, 67, 1499-1521及び米国特許第5,376,677号に教示されている。

#### 【0138】

## 【化 15】

## スキーム 5



10

## 【0139】

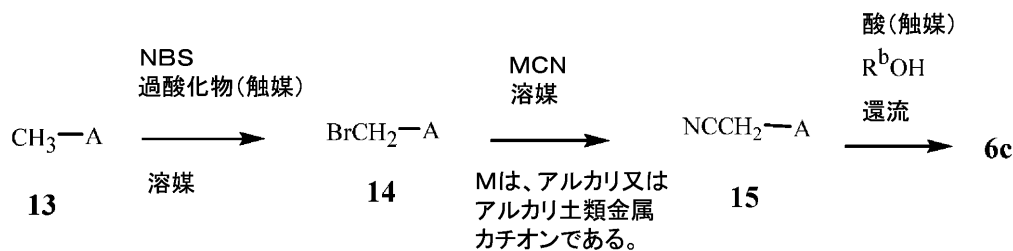
式 6 c のヘテロアリアル酢酸エステルを作製するための代替的な方法を、スキーム 6 に概説する。Pest. Manag. Sci. 2011, 67, 1499-1521 における方法によって教示されるように、式 13 のメチル複素環を、遊離ラジカル条件下（例えば、触媒として過酸化ベンゾイル）下で、ジクロロメタン、ジクロロエタン、又はテトラクロロメタンなどの不活性溶媒中で、N-ブロモスクシンイミド（NBS）で臭素化して、式 14 のヘテロアリアルメチルブロミドを得ることができる。式 14 の化合物をアルカリ又はアルカリ性シアン化物（例えば、シアン化カリウム）と反応させることによって、臭素をシアン化物で置換することにより、一般に溶媒の還流温度で酸性アルコール（例えば、メタノール又はエタノール中の HCl）中で加熱することによって、式 6 c のアセ

20

## 【0140】

## 【化 16】

## スキーム 6



30

## 【0141】

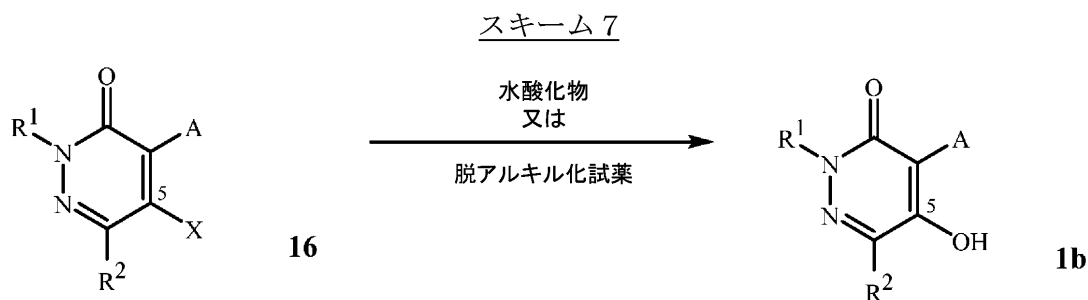
ピリダジノン環の 5 位における脱離基の加水分解は、スキーム 7 に示されるように達成することができる。X 基が低級アルコキシ、低級アルキルスルフィド（スルホキシド又はスルホン）、ハロゲン化物又は N-結合アゾールである場合、これは、0 ~ 120 の温度でテトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、又はジオキサンなどの溶媒中でテトラブチルアンモニウムヒドロキシドなどの塩基性試薬で加水分解することによって除去することができる。この加水分解に有用な他の水酸化物試薬としては、カリウム、リチウム及び水酸化ナトリウムが挙げられる（例えば、国際公開第 2009/086041 号を参照されたい）。X 基が低級アルコキシである場合、X 基の加水分解はまた、三臭化ホウ素又はモルホリンなどの脱アルキル化試薬により達成され得る（例えば、国際公開第 2009/086041 号、国際公開第 2013/160126 号及び国際公開第 2013/050421 号を参照されたい）。

40

## 【0142】



## 【化 17】

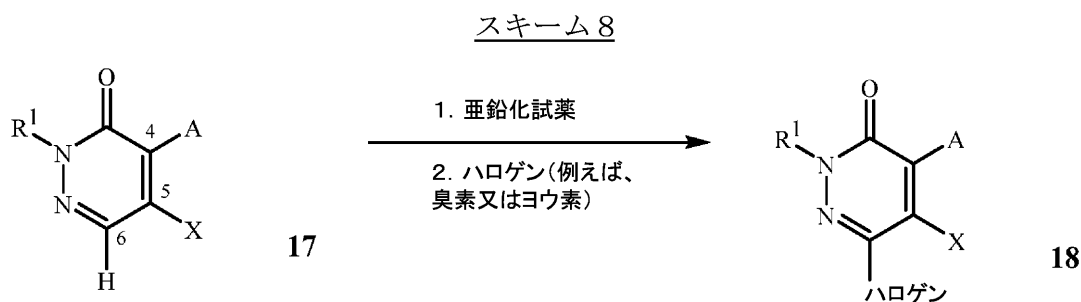


## 【0143】

ピリダジノンの6位でのハロゲンの導入は、亜鉛化、続いてハロゲン化によって達成することができる。ピリダジノンの亜鉛化の条件、試薬及び例については、Verhelst, T., Ph.D. thesis, University of Antwerp, 2012を参照されたい。典型的には、式17のピリダジノンを、 $Zn(TMP) \cdot LiCl$ 、又は $Zn(TMP)_2 \cdot MgCl_2 \cdot LiCl$ の溶液（すなわち、トルエン/テトラヒドロフラン中の2,2,6,6-ビス(テトラメチルピペリジン)亜鉛、塩化マグネシウム、塩化リチウム錯体）の溶液で、テトラヒドロフラン中、 $-20 \sim 30$  で処理して、亜鉛試薬を形成する。その後、臭素、N-ブロモスクシンイミド又はヨウ素を添加することにより、式18の化合物（式中、 $R^2$  は、それぞれBr又はIである）を提供する。トリクロロイソシアヌル酸又は1,3-ジクロロ-5,5-ジメチルヒダントインなどの試薬は、式18の化合物（式中、 $R^2$  は、Clである）を与える。この方法をスキーム8に示す。様々な適切な亜鉛化試薬の調製のためには、Wunderlich, S. Ph.D. thesis, University of Munich, 2010及びその中で引用された参考文献、並びに国際公開第2008/138946号及び国際公開第2010/092096号を参照されたい。ピリダジノン環の6位における亜鉛化は、ピリダジノン環の4位における芳香族/ヘテロ芳香族置換基、アルコキシ置換基若しくはハロゲンの存在下、又はピリダジノン環の5位におけるハロゲン若しくはアルコキシ置換基の存在下で達成され得る。

## 【0144】

## 【化 18】



## 【0145】

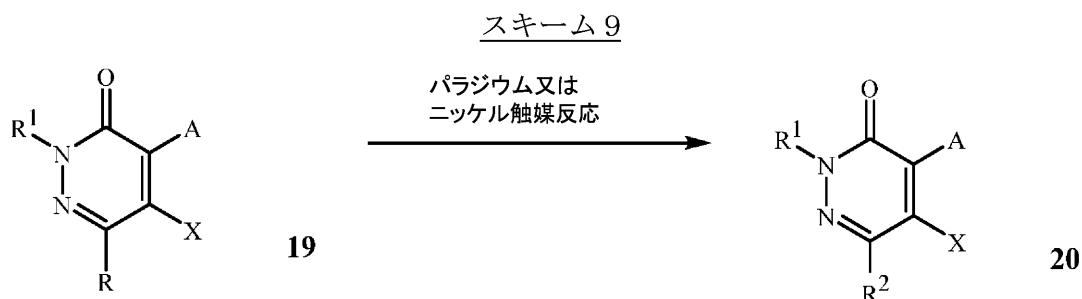
式19の化合物の $R^2$ 置換基（式中、 $R^2$  は、ハロゲン又はスルホネートである）を、他の官能基に更に変換することができる。 $R^2$  がアルキル、シクロアルキル又は置換アルキルである化合物は、スキーム9に示すように、式19の化合物の遷移金属触媒反応によって調製することができる。これらの種類の反応のレビューについては、E. Negishi, Handbook of Organopalladium Chemistry for Organic Synthesis, John Wiley and Sons, Inc., New York, 2002, N. Miyaura, Cross-Coupling Reactions: A Practical Guide, Springer, New York, 2002, H.C. Brown et al., Organic Synthesis via Boranes, Aldrich Chemical Co., Milwaukee, Vol. 3, 2002, Suzuki et al

、Chemical Reviews 1995, 95, 2457-2483、及びMolander et al., Accounts of Chemical Research 2007, 40, 275-286を参照されたい。また、Tetrahedron Organic Chemistry Series Vol. 26: Palladium in Heterocyclic Chemistry, 2nd Ed., Gribble and Li, editors, Elsevier, Amsterdam, 2007も参照されたい。Buchwald-Hartwig chemistryのレビューについては、Yudin and Hartwig, Catalyzed Carbon-Heteroatom Bond Formation, 2010, Wiley, New Yorkを参照されたい。

10

【0146】

【化19】



20

Rは、ハロゲン又はスルホネートである

Rは、アルキル、シクロアルキル、又は置換アルキルである

【0147】

式21のR<sup>2</sup>位に他の官能基を導入するための関連する合成方法は、当該技術分野において既知である。銅触媒反応は、CF<sub>3</sub>基を導入するのに有用である。Wu, Neumann and Beller in Chemistry: An Asian Journal, 2012, ASAP及びその中で引用された参考文献を参照されたい。この位置に硫黄含有置換基を導入するために、国際公開第2013/160126号に開示されている方法を参照されたい。シアノ基の導入については、国際公開第2014/031971号を参照されたい。ニトロ基の導入については、J. Am. Chem. Soc. 2009, 12898を参照されたい。フルオロ置換基の導入については、J. Am. Chem. Soc. 2014, 3792を参照されたい。

30

【0148】

スキーム10に示すように、式19の化合物は、式22の有機金属試薬と式21のピリダジノンとを4位の反応基と反応させることによって調製することができる。脱離基に応じて、遷移金属触媒が望ましい場合がある。脱離基が低級アルコキシ、N-結合アゾール（ピラゾール若しくはトリアゾールなど）又はスルホネートである場合、触媒は必要ではなく、マグネシウム試薬又はリチウム試薬と直接反応することが4位で起こり得る。この反応は、有機マグネシウム試薬と反応しない様々な溶媒中で行うことができる。典型的な反応条件としては、溶媒としてテトラヒドロフラン、-20～65の反応温度、及び過剰の有機マグネシウム又は有機リチウム試薬が挙げられる。4位の反応基がハロゲンである場合、遷移金属触媒及び配位子が有用である。ホウ素（鈴木反応（Suzuki Reaction））、スズ（スティール反応（Stille Reaction））、及び亜鉛（根岸反応（Negishi reaction））を含む様々な異なるカップリングパートナーを使用することができ、これらの反応は、広範な配位子を有するパラジウム及びニッケル触媒によって触媒され得る。これらの反応の条件は、当該技術分野において既知である。例えば、Palladium-Catalyzed Coupling Reactions: Practical Aspects and Future Development Edited by Arpad Molnar, Wiley, 2013及びその中に引用された参考文献を参照されたい。非触媒プロセスで使用される有機マグネシウム試薬は、炭素-ハロゲン結合へのマグネシウムの直接導入によって（任意にリチウムハロゲン化物の存在下で）、又はi-

40

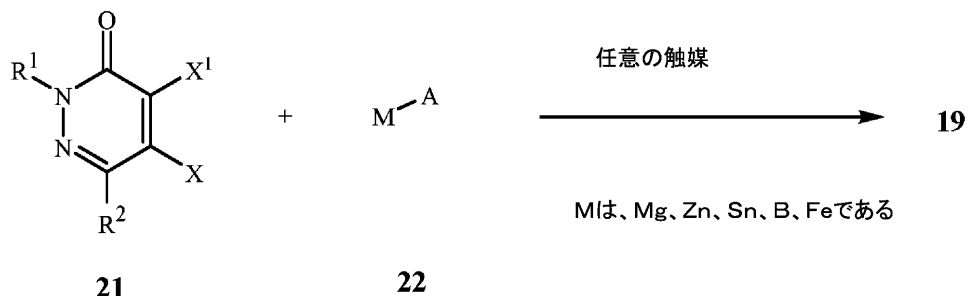
50

プロピルマグネシウムハロゲン化物とのグリニユール交換反応によって（任意にリチウムハロゲン化物の存在下で）、又は臭化マグネシウムエーテラートなどのマグネシウム塩と反応させることによる有機リチウム試薬の変換によって調製することができる。有機マグネシウム試薬に対して不活性である様々な基は、これらの反応物における、 $R^2$ 及びピリダジノンの5位に存在し得る。式21の化合物は、Knochel et al. Angew. 2011, 50, 9794-9824、及びHeterocycles 2014, 88, 827-844で見出される方法に従って調製することができる。

【0149】

【化20】

スキーム10



10

【0150】

式21の化合物は、当該技術分野において既知であるか、又は、Maes and Lemiere in Comprehensive Heterocyclic Chemistry III Volume 8, Katritzky, Ramsden, Scriven and Taylor editors及びその中で引用された参考文献に記載されている方法によって調製することができる。また、Verhelst, Ph. D. thesis University of Antwerp及びその中で引用された参考文献も参照されたい。ピリダジノンに対する官能基変換は、Stevenson et al. J. Heterocyclic Chem. 2005, 42, 427; 米国特許第6,077,953号; 国際公開第2009/086041号及びその中に引用された参考文献; 米国特許第2,782,195号; 国際公開第2013/160126号及び国際公開第2013/050421号にも記載されている。

20

30

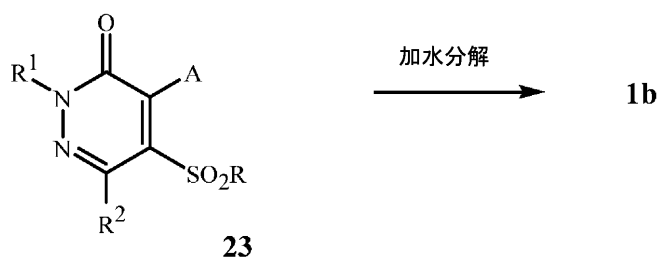
【0151】

式1bの化合物はまた、水性塩基中の式23のスルホンを加水分解することによっても調製することができる。好適な塩基としては、ナトリウム、カリウム、又はテトラブチルアンモニウムヒドロキシドが挙げられる。典型的な反応温度は0～80の範囲であり、典型的な反応時間は1～12時間である。この方法をスキーム11に示す。

【0152】

【化21】

スキーム11



40

【0153】

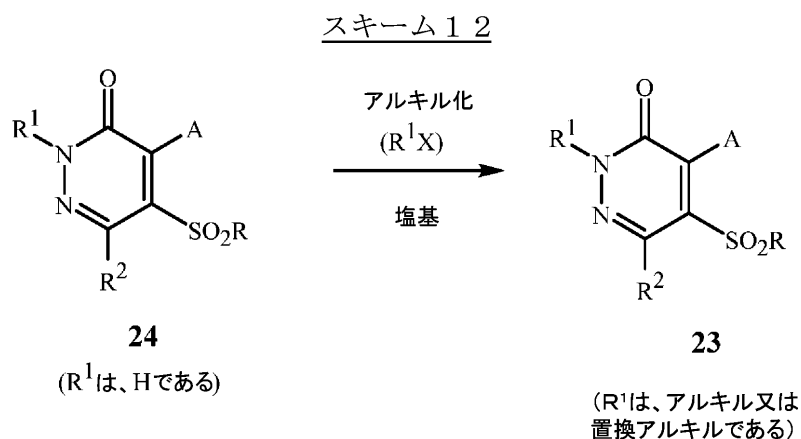
式23の化合物は、式24の化合物（式中、 $R^1$ は、Hである）のアルキルハロゲン化物及びスルホネートを用いたアルキル化によって調製することができる。この方法で有用な典型的な塩基としては、カリウム、ナトリウム、又は炭酸セシウムが挙げられる。典

50

型的な溶媒としては、スキーム 1 2 に示されるような、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、又は N, N - ジメチルホルムアミドが挙げられる。

【 0 1 5 4 】

【 化 2 2 】



10

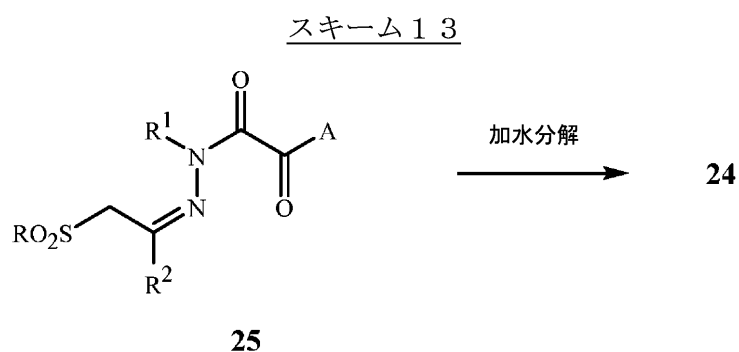
【 0 1 5 5 】

式 2 4 の化合物は、塩基による処理によって式 2 5 の化合物の環化によって調製することができる。この方法で有用な典型的な塩基としては、カリウム、ナトリウム、又は炭酸セシウムが挙げられる。典型的な溶媒としては、スキーム 1 3 に示されるような、アセ

20

【 0 1 5 6 】

【 化 2 3 】



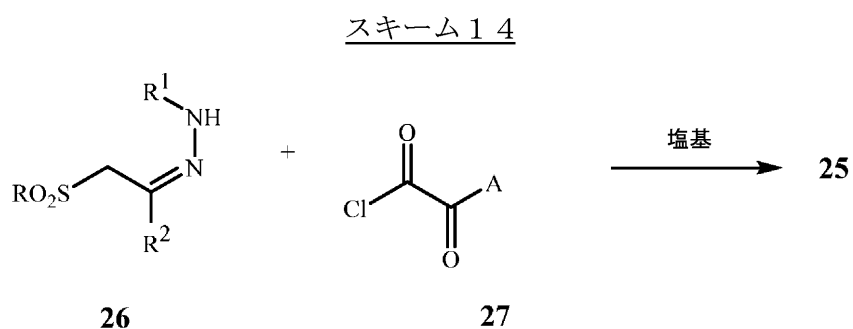
30

【 0 1 5 7 】

式 2 5 の化合物は、スキーム 1 4 に示される方法によって調製することができる。この方法では、式 2 6 の化合物は、塩基の存在下で式 2 7 の化合物と結合される。この方法で有用な塩基としては、トリエチルアミン、炭酸ナトリウム若しくは炭酸カリウム、ピリジン、又はジイソプロピルエチルアミンが挙げられる。

【 0 1 5 8 】

【 化 2 4 】



40

【 0 1 5 9 】

式 2 6 の化合物は、当該技術分野において既知の方法によって調製することができる

50

。

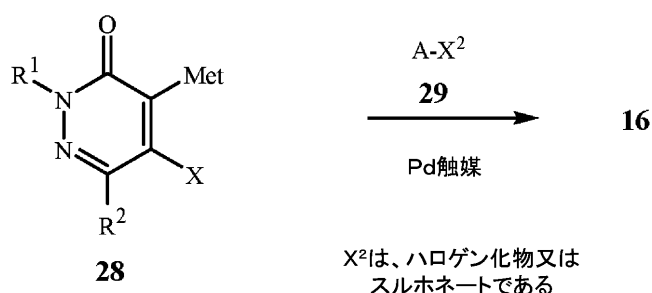
## 【0160】

式16の化合物は、式28の有機金属ピリダジノンカップリングパートナーと、式29のヘテロアリアルハロゲン化物及びスルホネートとのカップリング反応によって調製することができる。有機金属カップリングパートナーは、例えば、有機亜鉛、有機マグネシウム、有機スズ、又は有機ホウ素試薬であり得る。パラジウム触媒、例えば、パラジウムテトラキス(トリフェニルホスフィン)、並びに $Pd_2dba_3$ 及び $Pd(OAc)_2$ などの他のパラジウム源から生成されたパラジウム触媒、並びにホスフィン又はN-複素環式カルベン配位子をカップリング手順に使用することができる(Maes et al. J. Org. Chem. 2011, 76, 9648-9659)。X-Phos、S-Phos、及びRu-Phosなどのジアルキルビアリアルホスフィン配位子に基づくパラジウム触媒(Buchwald et al. Angew. Chem. Int. Ed., 2013, 52(2), 615-619)、又はPEPPSI-i-Pr及びPEPPSI-i-PentなどのN-複素環式カルベン配位子に由来するプレ触媒(Organ et al. Eur. J. Org. Chem. 2010, 4343~4354)もまた、このカップリングを同じようにもたすことができる。この反応は、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、N-メチル-2-ピロリドン及びジオキサンなどの溶媒中で実施することができる。カップリングパートナーは、複素環式ハロゲン化物又はスルホネートのいずれかであってもよい。反応のための特に有用な部類のカップリングパートナーは、ヘテロ芳香族化合物のノナフラート( $OSO_2C_4F_9$ )に基づくものである。ハロゲン化複素環式カップリングパートナーは、市販されているか、又は文献で知られている。他の有用な部類の複素環式ハロゲン化物及び合成経路は、Tetrahedron Organic Chemistry Series Vol. 26: Palladium in Heterocyclic Chemistry, 2nd Ed., Gribble and Li, editors, Elsevier, Amsterdam, 2007に提供されている。

## 【0161】

## 【化25】

スキーム15



## 【0162】

ピリダジノンの4位の亜鉛化は、トルエン/テトラヒドロフラン中の2,2,6,6-ビス(テトラメチルピペリジン)亜鉛、塩化マグネシウム、塩化リチウム錯体(すなわち、 $Zn(TMP) \cdot LiCl$ 又は $Zn(TMP)_2 \cdot MgCl_2 \cdot LiCl$ )などの亜鉛化試薬で達成することができる。

## 【0163】

この位置のマグネシウム化(Magnesiumation)はまた、 $Mg(TMP) \cdot LiCl$ による処理によっても達成することができる。ピリダジノン金属化の条件及び4-亜鉛化並びに、4-マグネシウム化(magnesiated)ピリダジノンのパラジウム触媒クロスカップリングについて、Verhelst, Ph.D. thesis University of Antwerp, 2012を参照されたい。4-スタンニルピリダジノンの合成及びクロスカップリング条件は、Stevenson et al. J. Heterocyclic Chem. 2005, 42, 427から既知である。

## 【 0 1 6 4 】

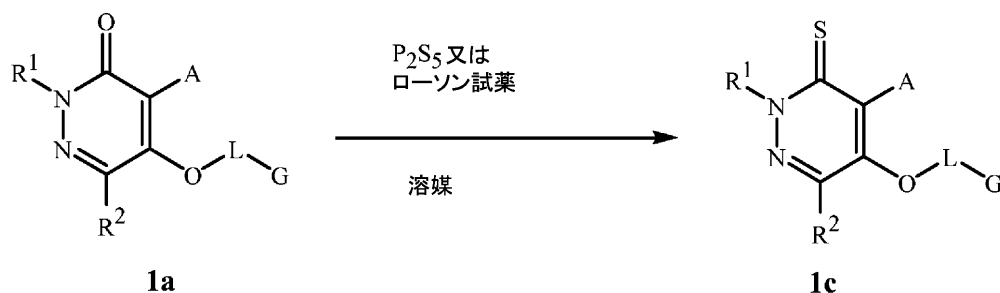
スキーム 16 に示されるように、概ね 0 から室温までの温度で、式 1 a のピリダジノン (W が O である式 1 の化合物のサブセット) をチオンして、チオン化試薬で、式 1 c (即ち、W が S である式 1) の対応するチオンを得ることができ、それは、一般的に、ピリジン中の五硫化リンであるか、又は適切な溶媒 (例えば、トルエン、テトラヒドロフラン又はジオキサン) 中のローソン試薬 (Lawesson's reagent) (2, 4 - ビス - (4 - メトキシフェニル) - 1, 3 - ジチア - 2, 4 - ジホスフェタン 2, 4 - ジスルフィド) である。

## 【 0 1 6 5 】

## 【 化 2 6 】

10

スキーム 16



## 【 0 1 6 6 】

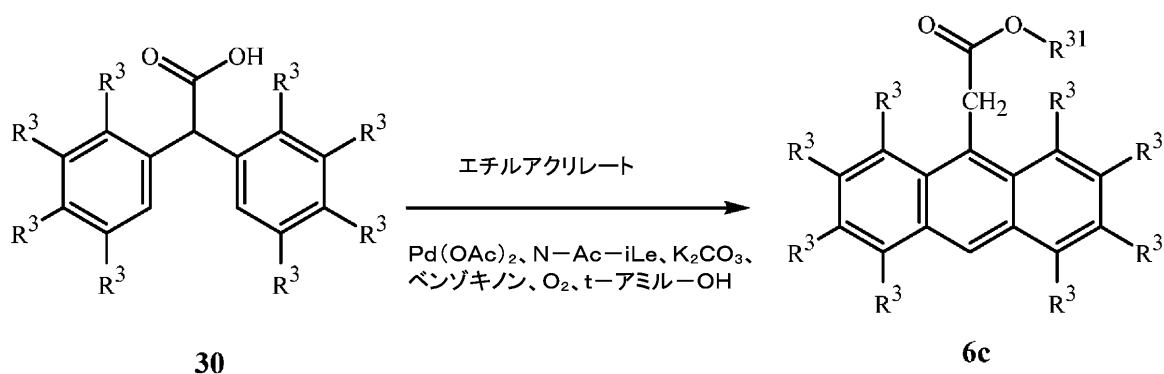
20

式 6 c の化合物 (式中、A = A - 1 及び  $R^{31} = Et$ ) は、酸素雰囲気下で、tert - アミルアルコール中の酢酸パラジウム (II)、ベンゾキノ、N - アセチル - イソロイシン、及びカリウム炭酸カリウムの存在下で、式 30 のジアリール酢酸のエチルアクリレートとの反応によって、Angew. Chem. Int. Ed., 2016, 55, 8652 - 8655 に記載された手順を用いて、かつスキーム 17 に示すとおりに調製することができる。

## 【 0 1 6 7 】

## 【 化 2 7 】

スキーム 17

A=A-1であり、 $R^{31}$ は、Etである

40

## 【 0 1 6 8 】

様々な官能基を別の官能基に転換して、異なる式 1 の化合物を得ることができるが、当業者により認識されている。簡便かつ明快な方法で官能基の転換を説明している、価値ある資料については、Larock, R. C., Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations, 2nd Ed., Wiley-VCH, New York, 1999を参照のこと。例えば、式 1 の化合物調製のための中間体は、芳香族ニトロ基を含有してもよく、これはアミノ基に還元され得、次いで、サンドマイヤー反応 (Sandmeyer reaction) などの当該技術分野において周知の反応を介して様々なハロゲン化物に変換し、式 1 の化合物を得ることができる。上記の反応はまた、多くの場

50

合、代替的な順序で実施され得る。

#### 【0169】

式1の化合物を調製するために上述したいくつかの試薬及び反応条件は、中間体に存在する特定の官能基(functionality)と適合しない場合のものが有り得ることが認識されている。これらの例において、保護/脱保護の順序、又は官能基の相互転換を合成に組み込むことが、所望の生成物を得るのに役立つ。保護基の使用及び選択は、化学合成の当業者には明らかであろう(例えば、Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991を参照されたい)。当業者は、場合によっては、任意の個別のスキームで示されているように所与の試薬を導入した後、詳述されていない追加のルーチン合成工程を行い、式1の化合物の合成を完了することが必要となる場合があることを理解するであろう。具体的に示されたものにより示唆されるものの以外の順序で、上記スキームに示される工程の組み合わせを実施し、式1の化合物を調製する必要があることともまた、当業者は理解するであろう。

#### 【0170】

式1の化合物、及び本明細書に記載する中間体を、様々な求電子性反応、求核性反応、ラジカル反応、有機金属反応、酸化反応、及び還元反応に通して、置換基を加える、又は存在する置換基を修飾可能であることもまた、当業者は理解するであろう。

#### 【0171】

更なる説明なしに、先行する説明を用いる当業者は、本発明を最大限に活用することが可能であると考えられている。以下の非限定的な実施例は、本発明の例示である。以下の実施例における工程は、全体の合成変換における各工程の手順、及び、各工程の出発物質が必ずしも、手順が他の実施例又は工程で説明されている特定の調製の実施により調製される必要はないことについて示している。クロマトグラフ溶媒混合液、又は別様に指示される場合を除いて、百分率は重量による。クロマトグラフ溶媒混合液の部及び百分率は、特に断りのない限り、体積による。全てのNMRスペクトルは、特に指示がない限り、500 MHzでテトラメチルシランからの<sup>1</sup>CDCl<sub>3</sub>低磁場で報告され、sは一重項を意味し、br sは幅広一重項を意味し、dは二重項を意味し、tは三重項を意味し、mは多重項を意味する。

#### 【0172】

##### 合成例1

4-(9-アントラセニル)-6-クロロ-5-ヒドロキシ-2-メチル-3(2H)-ピリダジノン(化合物1)の調製

工程A: 4-(9-アントラセニル)-6-クロロ-5-メトキシ-2-メチル-3(2H)-ピリダジノンの調製

2, 2, 6, 6-テトラメチルピペリジニルマグネシウムクロリド塩化リチウム錯体溶液(テトラヒドロフラン/トルエン中1.0 M、38.0 mL、38.0 mmol)に、氷水冷浴を使用して、15 未満の温度で、塩化亜鉛(2-メチルテトラヒドロフラン中1.9 M溶液10 mL、19.0 mmol)の溶液を添加した。得られた溶液を5 で15分間攪拌し、25 で45分間攪拌した。得られたビス(2, 2, 6, 6-テトラメチルピペリジニル)亜鉛、塩化リチウム、塩化マグネシウム錯体の溶液を添加漏斗(addition funnel)に移し、-40 で6-クロロ-5-メトキシ-2-メチル-3(2H)-ピリダジノン(3.0 g、17.2 mmol)及びテトラヒドロフラン(86 mL)の懸濁液に滴加した。得られた溶液を-40 で15分間攪拌し、5 に温め、5 で45分間攪拌した。溶液を、9-ブromoアントラセン(4.2 g、16.3 mmol)及びSPhosプレ触媒-G2(クロロ(2-ジシクロヘキシルホスフィノ)-2', 6'-ジメトキシ-1, 1'-ビフェニル)[2-(2'-アミノ-1, 1'-ビフェニル)]パラジウム(II)、1.2 g、1.7 mmol)で連続的に処理した。得られた暗褐色溶液を、溶媒の還流温度で3時間加熱し、周囲温度まで冷却し、濃縮した。残留物を酢酸エチルと飽和塩化アンモニウム水溶液との間で分配し、得られた水層を酢酸エチルで抽出し、

合わせた有機層を水及び食塩水 (brine) で連続的に洗浄し、無水  $\text{MgSO}_4$  上で乾燥させ、濾過し、濃縮して、8.63 g の黄色油状物を得た。油状物を、ヘキサン中 0% ~ 100% 酢酸エチルの勾配で溶出するシリカゲル (330 g) カラムクロマトグラフィーによって精製し、3.35 g の標記化合物を油状固形物 (oily solid) として得た。

$^1\text{H}$  NMR 8.57 (s, 1H), 8.08 - 8.03 (m, 2H), 7.69 - 7.63 (m, 2H), 7.53 - 7.45 (m, 4H), 3.82 (s, 3H), 3.05 (s, 3H)。

【0173】

工程 B: 4 - (9 - アントラセニル) - 6 - クロロ - 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 (2H) - ピリダジノンの調製

10

工程 A からの生成物 2.15 g (6.1 mmol) とモルホリン (12 mL) との混合物を 100 で 2 時間加熱した。得られた反応混合物を濃縮し、残留物をジエチルエーテルでトリチュレートした (triturate)。濾過後、得られた固形物をジエチルエーテルで洗浄し、フリット漏斗 (fritted funnel) で乾燥させた。得られた固形物を 1 N 塩酸水溶液 (約 30 mL) 中に懸濁させた、周囲温度で 2 時間攪拌し、濾過した。固形物を水で洗浄し、真空下で乾燥させて、1.50 g の本発明の化合物である標記化合物を淡黄色固形物として得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{DMSO}-d_6$ ) 8.70 (s, 1H), 8.15 (d, 2H), 7.68 (d, 2H), 7.52 (t, 2H), 7.45 (t, 2H), 5.75 (s, 1H), 3.67 (s, 3H)。

20

【0174】

合成例 2

6 - クロロ - 4 - (10 - クロロ - 9 - アントラセニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 (2H) - ピリダジノン (化合物 2) の調製

工程 A: 6 - クロロ - 4 - (10 - クロロ - 9 - アントラセニル) - 5 - メトキシ - 2 - メチル - 3 (2H) - ピリダジノンの調製

合成例 1 の工程 A の生成物 (143 mg, 0.41 mmol)、N - クロロスクシンイミド (65 mg, 0.49 mmol) 及びクロロホルム (4 mL) の溶液を室温で 15 時間攪拌した。得られた溶液をジクロロメタンで希釈し、水で 2 回洗浄し、有機層を無水  $\text{MgSO}_4$  上で乾燥させ、濾過し、濃縮して、黄色のガラス状物として 160 mg の標記化合物を得た。粗生成物を更に精製することなく次の工程で使用した。

30

$^1\text{H}$  NMR 8.60 (d, 2H), 7.69 (d, 2H), 7.62 (歪んだ (distorted) t, 2H), 7.53 (歪んだ t, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.09 (s, 3H)。

【0175】

工程 B: 6 - クロロ - 4 - (10 - クロロ - 9 - アントラセニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 (2N) - ピリダジノンの調製

工程 A の生成物 155 mg とモルホリン (1 mL) との懸濁液を 100 で 2 時間加熱した。得られた混合物をジエチルエーテル (5 mL) で希釈し、30 分間攪拌し、得られた上澄み液を固形生成物からデカントした。固形生成物をジクロロメタンと 1 N 塩酸水溶液との間で分配し、有機層を無水  $\text{MgSO}_4$  上で乾燥させて、濾過し、濃縮して、120 mg の標記化合物を黄色固形物として得た。

40

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{DMSO}-d_6$ ) 8.52 (d, 2H), 7.61 (d, 2H), 7.74 (歪んだ t, 2H), 7.56 (歪んだ t, 2H), 3.67 (s, 3H)。

【0176】

本明細書に記載される手順と当該技術分野において既知の方法により、以下の表 1 ~ (960) の化合物を調製することができる。以下の表において以下の略語を使用する: t は三級を意味し、s は二級を意味し、n は、ノルマルを意味し、i は、イソを意味し、C は、シクロを意味し、Me は、メチルを意味し、Et は、エチルを意味し、Pr は、プロピルを意味し、Bu はブチルを意味し、i - Pr はイソプロピルを意味し、c - Pr は

50



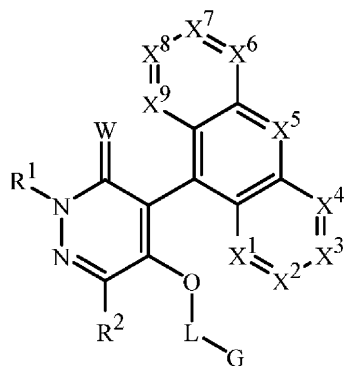
、シクロプロピルを意味し、t - B u は三級ブチルを意味し、P h はフェニルを意味し、O M e は、メトキシを意味し、O E t はエトキシを意味し、S M e は、メチルチオを意味し、- C N は、シアノを意味し、- N O<sub>2</sub> は、ニトロを意味し、T M S は、トリメチルシリルを意味し、S O M e は、メチルスルフィニルを意味し、C<sub>2</sub> F<sub>5</sub> は、C F<sub>2</sub> C F<sub>3</sub> を意味し、S O<sub>2</sub> M e は、メチルスルホニルを意味する。

【 0 1 7 7 】

表 1

【 0 1 7 8 】

【 化 2 8 】



W = O、R<sup>1</sup> = M e、R<sup>2</sup> = M e、L - G = Hであり、残りの変数は以下に定義される。 20

【 0 1 7 9 】

【表 3 - 1】

X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CH	Cl	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	10
CH	CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CH	N	CH	CH	CH	CH	
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	20
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	N	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	30
CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	40
CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	N	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CF	CH	

【 0 1 8 0 】

【表 3 - 2】

(上記表の続き)

X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CBr	CH	
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	Cl	CH	
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	10
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH	
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CBr	CH	
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	Cl	CH	
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	20
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH	
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CBr	CH	
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	Cl	CH	30
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH	
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	Cl	CH	40
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	

【表 3 - 3】

(上記表の続き)

X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	10
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	20
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	30
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	40
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH	
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH	
CH	N	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH	
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	

【 0 1 8 2 】

【表 3 - 4】

(上記表の続き)

X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	10
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CH	N	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CH	Cl	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	20
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CH	N	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CF	CH	30
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	Cl	CH	
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	40
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH	
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	Cl	CH	
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	

【 0 1 8 3 】

【表 3 - 5】

(上記表の続き)

X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	10
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH	
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	Cl	CH	
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	20
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH	
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	Cl	CH	
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	30
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	40
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	

【 0 1 8 4 】

【表 3 - 6】

(上記表の続き)

X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	10
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	20
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH	
CH	C-NO <sub>2</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	C-NO <sub>2</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH	
CH	N	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH	
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CF	CH	30
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	Cl	CH	
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	40
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH	
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	Cl	CH	
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	

【 0 1 8 5 】

【表 3 - 7】

(上記表の続き)

X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	10
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH	
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	Cl	CH	
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	20
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH	
CH	Cl	CH	CH	CBr	CH	CH	Cl	CH	
CH	Cl	CH	CH	CBr	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	
CH	Cl	CH	CH	CBr	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	
CH	Cl	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	Cl	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	Cl	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	Cl	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	30
CH	Cl	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	Cl	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	40
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	

【 0 1 8 6 】



【表 3 - 8】

(上記表の続き)

X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	10
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	20
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH	
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH	
CH	N	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH	
CH	CH	CH	CF	CH	CF	CH	CH	CH	30
CH	CH	CH	CCl	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CBr	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	Cl	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF	CH	CH	CH	40
CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	N	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCl	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CBr	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	Cl	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CCl	CH	CH	CH	

【 0 1 8 7 】

【表 3 - 9】

(上記表の続き)

X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	
CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CCl	CH	CH	CH	10
CH	CH	CH	N	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CBr	CH	CBr	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	Cl	CH	CBr	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CBr	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CBr	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CBr	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CBr	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CBr	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CBr	CH	CH	CH	20
CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CBr	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	N	CH	CBr	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	Cl	CH	Cl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	Cl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	Cl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	Cl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	Cl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	Cl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	Cl	CH	CH	CH	30
CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	Cl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	N	CH	Cl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	40
CH	CH	CH	N	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	

【表 3 - 1 0】

(上記表の続き)

X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	
CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	N	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	10
CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	N	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	N	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	20
CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	N	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	N	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	N	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	N	CH	N	CH	CH	CH	
CH	CF	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH	30
CH	CCl	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	CBr	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	Cl	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH	40
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	N	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH	
CH	CCl	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	CBr	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	Cl	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	

【 0 1 8 9 】

【表 3 - 1 1】

(上記表の続き)

X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	10
CH	N	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	CBr	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	
CH	Cl	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	20
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	
CH	N	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	
CH	Cl	CH	CH	CH	Cl	CH	CH	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	Cl	CH	CH	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	Cl	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	Cl	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	Cl	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	Cl	CH	CH	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	Cl	CH	CH	CH	30
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	Cl	CH	CH	CH	
CH	N	CH	CH	CH	Cl	CH	CH	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	40
CH	N	CH	CH	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	

【 0 1 9 0 】

【表 3 - 1 2】

(上記表の続き)

X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	N	CH	CH	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	10
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	
CH	N	CH	CH	CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	N	CH	CH	CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	20
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	N	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	N	CH	CH	CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	
CH	N	CH	CH	CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CH	CH	
CH	N	CH	CH	CH	N	CH	CH	CH	
CH	CF	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	30
CH	CCl	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CBr	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	Cl	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	40
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	N	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CF	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCl	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CBr	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	Cl	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	

【 0 1 9 1 】

【表 3 - 1 3】

(上記表の続き)

X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	10
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	N	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CF	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCl	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CBr	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	Cl	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	20
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	N	CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CF	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCl	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CBr	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	Cl	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	30
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	N	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CF	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	40
CH	CCl	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CBr	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	Cl	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	COCH <sub>3</sub>	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	COCF <sub>2</sub> H	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	

【 0 1 9 2 】

【表 3 - 1 4】

(上記表の続き)

X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	
CH	COCF <sub>3</sub>	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CNO <sub>2</sub>	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	N	CH	CCF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	10
CH	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	C-Cl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CF	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CCl	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	20
CBr	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CCl	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CCl	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	
CCl	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CF	CH	
CCl	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CCl	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CBr	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CBr	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	
CBr	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CF	CH	30
CBr	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CBr	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CF	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CF	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CCl	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	C-Cl	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CF	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	40
CH	CCH <sub>3</sub>	CF	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CCl	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CCl	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CBr	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CCl	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CCl	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	

【 0 1 9 3 】

【表 3 - 1 5】

(上記表の続き)

X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	
CCl	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CF	CH	
CCl	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CCl	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CBr	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CBr	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	
CBr	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CF	CH	10
CBr	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CBr	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CF	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CF	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CCl	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	C-Cl	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CF	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	20
CH	CCH <sub>3</sub>	CF	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CCl	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CH	CCH <sub>3</sub>	CCl	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CBr	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CCl	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CCl	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	
CCl	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CF	CH	
CCl	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CCl	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	30
CBr	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CBr	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	
CBr	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CF	CH	
CBr	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CBr	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	

【0 1 9 4】

本開示はまた、表 2 ~ 4 8 を含み、表 1 のヘッダー行フレーズ（すなわち、「W = O、R<sup>1</sup> = Me、R<sup>2</sup> = Me、L - G = H」）は、それぞれの表に列挙されたヘッダー行フレーズに差し替えられ、残りの変数は表 1 に定義されるとおりである。

【0 1 9 5】



【表 4】

表	ヘッダー行フレーズ
2	$W=O, R^1=Me, R^2=Cl, L-G=H$
3	$W=O, R^1=Me, R^2=Br, L-G=H$
4	$W=O, R^1=Me, R^2=OCH_3, L-G=H$
5	$W=O, R^1=Et, R^2=CH_3, L-G=$
6	$W=O, R^1=Et, R^2=Cl, L-G=H$
7	$W=O, R^1=Et, R^2=Br, L-G=H$
8	$W=O, R^1=Et, R^2=OCH_3, L-G=H$
9	$W=O, R^1=CH_2CH_2OCH_3, R^2=CH_3, L-G=H$
10	$W=O, R^1=CH_2CH_2OCH_3, R^2=Cl, L-G=H$
11	$W=O, R^1=CH_2CH_2OCH_3, R^2=Br, L-G=H$
12	$W=O, R^1=CH_2CH_2OCH_3, R^2=OCH_3, L-G=H$
13	$W=O, R^1=Me, R^2=CH_3, L-G=C(O)CH_3$
14	$W=O, R^1=Me, R^2=Cl, L-G=C(O)CH_3$
15	$W=O, R^1=Me, R^2=Br, L-G=C(O)CH_3$
16	$W=O, R^1=Me, R^2=OCH_3, L-G=C(O)CH_3$
17	$W=O, R^1=Et, R^2=CH_3, L-G=C(O)CH_3$
18	$W=O, R^1=Et, R^2=Cl, L-G=C(O)CH_3$
19	$W=O, R^1=Et, R^2=Br, L-G=C(O)CH_3$
20	$W=O, R^1=Et, R^2=OCH_3, L-G=C(O)CH_3$
21	$W=O, R^1=CH_2CH_2OCH_3, R^2=CH_3, L-G=C(O)CH_3$
22	$W=O, R^1=CH_2CH_2OCH_3, R^2=Cl, L-G=C(O)CH_3$
23	$W=O, R^1=CH_2CH_2OCH_3, R^2=Br, L-G=C(O)CH_3$
24	$W=O, R^1=CH_2CH_2OCH_3, R^2=OCH_3, L-G=C(O)CH_3$
25	$W=O, R^1=Me, R^2=CH_3, L-G=C(O)CH_2CH_3$
26	$W=O, R^1=Me, R^2=Cl, L-G=C(O)CH_2CH_3$
27	$W=O, R^1=Me, R^2=Br, L-G=C(O)CH_2CH_3$
28	$W=O, R^1=Me, R^2=OCH_3, L-G=C(O)CH_2CH_3$
29	$W=O, R^1=Et, R^2=CH_3, L-G=C(O)CH_2CH_3$
30	$W=O, R^1=Et, R^2=Cl, L-G=C(O)CH_2CH_3$
31	$W=O, R^1=Et, R^2=Br, L-G=C(O)CH_2CH_3$
32	$W=O, R^1=Et, R^2=OCH_3, L-G=C(O)CH_2CH_3$
33	$W=O, R^1=CH_2CH_2OCH_3, R^2=CH_3, L-G=C(O)CH_2CH_3$
34	$W=O, R^1=CH_2CH_2OCH_3, R^2=Cl, L-G=C(O)CH_2CH_3$
35	$W=O, R^1=CH_2CH_2OCH_3, R^2=Br, L-G=C(O)CH_2CH_3$
36	$W=O, R^1=CH_2CH_2OCH_3, R^2=OCH_3, L-G=C(O)CH_2CH_3$
37	$W=O, R^1=Me, R^2=CH_3, L-G=C(O)OCH_3$
38	$W=O, R^1=Me, R^2=Cl, L-G=C(O)OCH_3$
39	$W=O, R^1=Me, R^2=Br, L-G=C(O)OCH_3$
40	$W=O, R^1=Me, R^2=OCH_3, L-G=C(O)OCH_3$
41	$W=O, R^1=Et, R^2=CH_3, L-G=C(O)OCH_3$
42	$W=O, R^1=Et, R^2=Cl, L-G=C(O)OCH_3$
43	$W=O, R^1=Et, R^2=Br, L-G=C(O)OCH_3$
44	$W=O, R^1=Et, R^2=OCH_3, L-G=C(O)OCH_3$
45	$W=O, R^1=CH_2CH_2OCH_3, R^2=CH_3, L-G=C(O)OCH_3$
46	$W=O, R^1=CH_2CH_2OCH_3, R^2=Cl, L-G=C(O)OCH_3$
47	$W=O, R^1=CH_2CH_2OCH_3, R^2=Br, L-G=C(O)OCH_3$
48	$W=O, R^1=CH_2CH_2OCH_3, R^2=OCH_3, L-G=C(O)OCH_3$

【0196】

表 4 9

【0197】

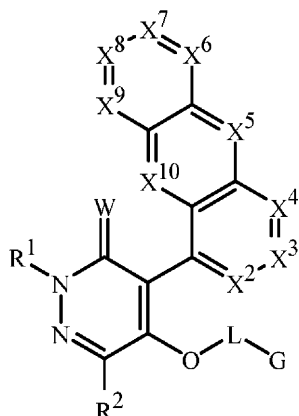
10

20

30

40

## 【化 2 9】



10

W = O、 $R^1 = CH_3$ 、 $R^2 = CH_3$ 、L G = Hであり、残りの変数は以下に定義される。

## 【0198】

【表 5】

X <sup>1</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	X <sup>10</sup>
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CF	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCl	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CF	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCl	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CBr	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CBr
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CCl

20

30

40

## 【0199】

本開示はまた、表 50 ~ 56 を含み、各表に列挙されている特定の変数は、表 49 のヘッダー行フレーズにおける対応する変数に置き換わる。例えば、表 50 では、ヘッダー

50

行フレーズは、「 $W = O$ 、 $R^1 = CH_3$ 、 $R^2 = Cl$ 、 $L - G = H$ 」であり、残りの変数は、以下に定義される。

【0200】

【表6】

表	ヘッダー行変数
50	$R^2 = Cl$
51	$R^2 = OCH_3$
52	$R^1 = CH_2CH_3$
53	$R^1 = CH_2CH_3$ 、 $R^2 = Cl$
54	$R^1 = CH_2CH_3$ 、 $R^2 = OCH_3$
55	$R^1 = CH_2CH_2OCH_3$
56	$R^1 = CH_2CH_2OCH_3$ 、 $R^2 = Cl$

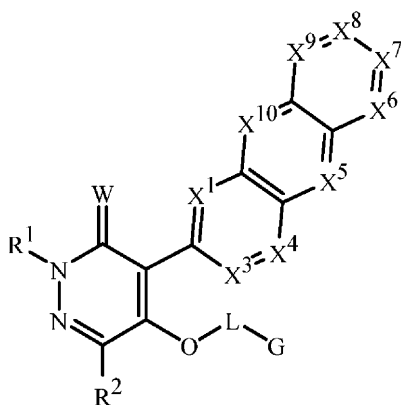
10

【0201】

表57

【0202】

【化30】



20

$W = O$ 、 $R^1 = CH_3$ 、 $R^2 = CH_3$ 、 $L - G = H$ であり、残りの変数は以下に定義される。

【0203】

【表 7】

X <sup>1</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	X <sup>10</sup>	
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CF	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CCl	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	10
CCH <sub>3</sub>	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CF	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CCl	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	20
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CBr	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CBr	30
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	

## 【0204】

本開示はまた、表 58 ~ 65 を含み、各表に列挙されている特定の変数は、表 57 のヘッダー行フレーズにおける対応する変数に置き換わる。例えば、表 58 では、ヘッダー行フレーズは、「 $W = O$ 、 $R^1 = CH_3$ 、 $R^2 = Cl$ 、 $L - G = H$ であり、残りの変数は、以下に定義される」である。

## 【0205】

【表 8】

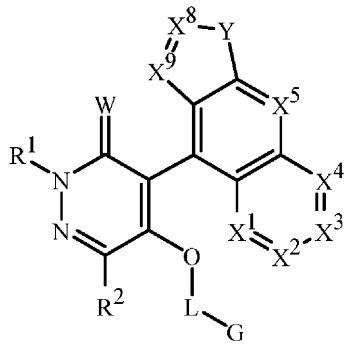
表	ヘッダー行変数	表	ヘッダー行変数
58	$R^2 = Cl$	62	$R^1 = CH_2CH_3$ 、 $R^2 = OCH_3$
59	$R^2 = OCH_3$	63	$R^1 = CH_2CH_2OCH_3$
60	$R^1 = CH_2CH_3$	64	$R^1 = CH_2CH_2OCH_3$ 、 $R^2 = Cl$
61	$R^1 = CH_2CH_3$ 、 $R^2 = Cl$	65	$R^1 = CH_2CH_2OCH_3$ 、 $R^2 = OCH_3$

## 【0206】

表 66

## 【0207】

## 【化 3 1】



W = O、 $R^1 = CH_3$ 、 $R^2 = CH_3$ 、Y = O、L - G = Hであり、残りの変数は以下に定義される。

## 【 0 2 0 8 】

## 【表 9】

X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH
CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH <sub>3</sub>	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH <sub>3</sub>	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH <sub>3</sub>	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH
Cl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
Cl	CF	CH	CH	CH	CH	CH
Cl	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
Cl	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CH	CCl	CH	CH
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH
CH	CH	CH	CH	CBr	CH	CH
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CBr	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCl	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CBr
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CCl
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>

10

20

30

40

50

【 0 2 0 9 】

本開示はまた、表 6 7 ~ 7 4 を含み、各表に列挙されている特定の変数は、表 6 6 のヘッダー行フレーズにおける対応する変数に置き換わる。例えば、表 6 7 のヘッダー行フレーズは、 $W = O$ 、 $R^1 = CH_3$ 、 $R^2 = CH_3$ 、 $Y = S$ 、 $L - G = H$ であり、残りの変数は以下に定義される。

【 0 2 1 0 】

## 【表 10】

表	ヘッダ行変数
67	$Y=S$
68	$Y=NCH_3$
69	$R^2=Cl$
70	$R^2=Cl, Y=S$

表	ヘッダー行変数
71	$R^2 = Cl, Y = NCH_3$
72	$R^2 = OCH_3$
73	$R^2 = OCH_3, Y = S$
74	$R^2 = OCH_3, Y = NCH_3$

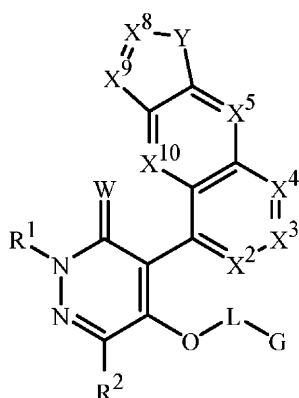
10

【 0 2 1 1 】

## 表 7 5

【 0 2 1 2 】

## 【化 3 2】



20

$W = O$ 、 $R^1 = CH_3$ 、 $R^2 = CH_3$ 、 $Y = O$ 、 $L - G = H$ であり、残りの変数は以下に定義される。

【 0 2 1 3 】

30

【表 1 1】

X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	X <sup>10</sup>	
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	
CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	
CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	10
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	
CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	
CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	20
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CBr	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CBr	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	30

【0 2 1 4】

本開示はまた、表 7 6 ~ 8 3 を含み、各表に列挙されている特定の変数は、表 7 5 のヘッダー行フレーズにおける対応する変数に置き換わる。例えば、表 7 6 のヘッダー行フレーズは、「 $W = O$ 、 $R^1 = CH_3$ 、 $R^2 = CH_3$ 、 $Y = S$ 、 $L - G = H$ ）であり、残りの変数は以下に定義される」である。

【0 2 1 5】

【表 1 2】

表	ヘッダー行変数	表	ヘッダー行変数
76	$Y = S$	80	$R^2 = Cl$ 、 $Y = NCH_3$
77	$Y = NCH_3$	81	$R^2 = OCH_3$
78	$R^2 = Cl$	82	$R^2 = OCH_3$ 、 $Y = S$
79	$R^2 = Cl$ 、 $Y = S$	83	$R^2 = OCH_3$ 、 $Y = NCH_3$

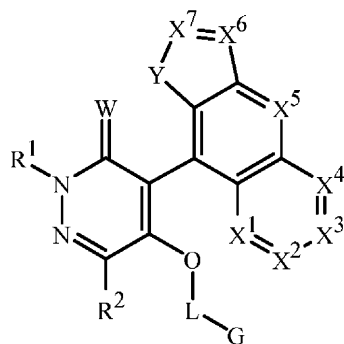
40

【0 2 1 6】

表 8 4

【0 2 1 7】

## 【化 3 3】



W = O、R<sup>1</sup> = CH<sub>3</sub>、R<sup>2</sup> = CH<sub>3</sub>、Y = O、L - G = Hであり、残りの変数は以下に定義される。

## 【 0 2 1 8】

## 【表 1 3】

X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH
CH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH <sub>3</sub>	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH <sub>3</sub>	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH <sub>3</sub>	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH
Cl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
Cl	CF	CH	CH	CH	CH	CH
Cl	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
Cl	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CH	CCl	CH	CH
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH
CH	CH	CH	CH	CBr	CH	CH
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CBr	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCl	CH
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CBr
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CCl
CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>

10

20

30

40

50



## 【 0 2 1 9 】

本開示はまた、表 8 5 ~ 9 2 を含み、各表に列挙されている特定の変数は、表 8 4 のヘッダー行フレーズにおける対応する変数に置き換わる。例えば、表 8 5 のヘッダー行フレーズは、「 $W = O$ 、 $R^1 = CH_3$ 、 $R^2 = CH_3$ 、 $Y = S$ 、 $L - G = H$ ）であり、残りの変数は、以下に定義される」である。

## 【 0 2 2 0 】

## 【表 1 4 】

表	ヘッダー行変数
85	$Y = S$
86	$Y = NCH_3$
87	$R^2 = Cl$
88	$R^2 = Cl$ 、 $Y = S$

表	ヘッダー行変数
89	$R^2 = Cl$ 、 $Y = NCH_3$
90	$R^2 = OCH_3$
91	$R^2 = OCH_3$ 、 $Y = S$
92	$R^2 = OCH_3$ 、 $Y = NCH_3$

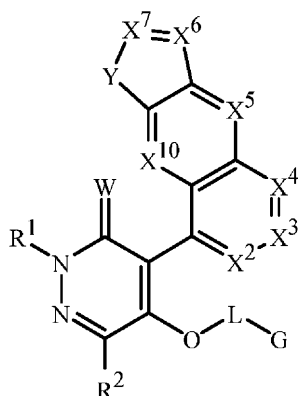
10

## 【 0 2 2 1 】

## 表 9 3

## 【 0 2 2 2 】

## 【化 3 4 】



20

$W = O$ 、 $R^1 = CH_3$ 、 $R^2 = CH_3$ 、 $L - G = H$ 、 $Y = O$ であり、残りの変数は以下に定義される。

## 【 0 2 2 3 】

30

【表 1 5】

X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>10</sup>	
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	
CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	
CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	10
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	
CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	
CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	20
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CBr	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CBr	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	30

## 【 0 2 2 4】

本開示はまた、表 9 4 ~ 1 0 1 を含み、各表に列挙されている特定の変数は、表 9 3 のヘッダー行フレーズにおける対応する変数に置き換わる。例えば、表 9 4 のヘッダー行フレーズは、「 $W = O$ 、 $R^1 = CH_3$ 、 $R^2 = CH_3$ 、 $L - G = H$ 、 $Y = S$ であり、残りの変数は以下に定義される」である。

## 【 0 2 2 5】

【表 1 6】

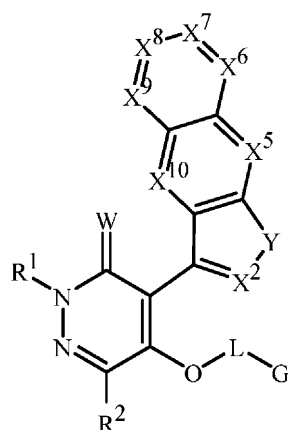
表	ヘッダー行変数	
94	$Y = S$	
95	$Y = NCH_3$	
96	$R^2 = Cl$	
97	$R^2 = Cl$ 、 $Y = S$	
98	$R^2 = Cl$ 、 $Y = NCH_3$	
99	$R^2 = OCH_3$	
100	$R^2 = OCH_3$ 、 $Y = S$	
101	$R^2 = OCH_3$ 、 $Y = NCH_3$	

## 【 0 2 2 6】

表 1 0 2

## 【 0 2 2 7】

## 【化 3 5】



1

W = O、 $R^1 = CH_3$ 、 $R^2 = CH_3$ 、L - G = H、Y = Oであり、残りの変数は以下に定義される。

## 【 0 2 2 8】

## 【表 1 7】

X <sup>2</sup>	X <sup>5</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	X <sup>10</sup>
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CBr	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCl	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CBr
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCl

## 【 0 2 2 9】

本開示はまた、表 1 0 3 ~ 1 1 0 を含み、各表に列挙されている特定の変数は、表 1 0 2 のヘッダー行フレーズにおける対応する変数に置き換わる。例えば、表 1 0 3 では、ヘッダー行フレーズは、「W = O、 $R^1 = CH_3$ 、 $R^2 = CH_3$ 、L - G = H、Y = S」であり、残りの変数は、以下に定義される」である。

## 【 0 2 3 0】

## 【表 1 8】

表	ヘッダー行変数
103	Y = S
104	Y = NCH <sub>3</sub>
105	R <sup>2</sup> = Cl
106	R <sup>2</sup> = Cl、Y = S

表	ヘッダー行変数
107	R <sup>2</sup> = Cl、Y = NCH <sub>3</sub>
108	R <sup>2</sup> = OCH <sub>3</sub>
109	R <sup>2</sup> = OCH <sub>3</sub> 、Y = S
110	R <sup>2</sup> = OCH <sub>3</sub> 、Y = NCH <sub>3</sub>

## 【 0 2 3 1】

10

20

30

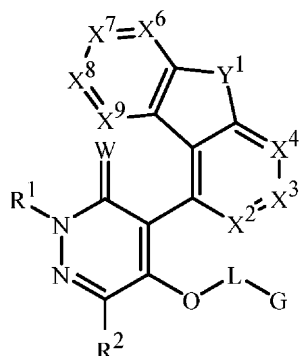
40

50

表 1 1 1

【 0 2 3 2 】

【 化 3 6 】



10

W = O、R<sup>1</sup> = CH<sub>3</sub>、R<sup>2</sup> = CH<sub>3</sub>、L - G = H、Y<sup>1</sup> = Oであり、残りの変数は以下に定義される。

【 0 2 3 3 】

【 表 1 9 】

X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CF	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CCl	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CH	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CF	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CCl	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CCH <sub>3</sub>	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CBr	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCl	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CBr
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCl
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>

20

30

40

【 0 2 3 4 】

本開示はまた、表 1 1 2 ~ 1 2 2 を含み、各表に列挙されている特定の変数は、表 1 1 1 のヘッダー行フレーズにおける対応する変数に置き換わる。例えば、表 1 1 2 のヘッ

50

ダー行フレーズは、「 $W = O$ 、 $R^1 = CH_3$ 、 $R^2 = CH_3$ 、 $L - G = H$ 、 $Y^1 = S$ であり、残りの変数は以下に定義される」である。

【 0 2 3 5 】

【表 2 0】

表	ヘッダー行変数
112	$Y^1 = S$
113	$Y^1 = NCH_3$
114	$Y^1 = C(O)$
115	$R^2 = Cl$
116	$R^2 = Cl, Y^1 = S$
117	$R^2 = Cl, Y^1 = NCH_3$

表	ヘッダー行変数
118	$R^2 = Cl, Y^1 = C(O)$
119	$R^2 = OCH_3$
120	$R^2 = OCH_3, Y^1 = S$
121	$R^2 = OCH_3, Y^1 = NCH_3$
122	$R^2 = OCH_3, Y^1 = C(O)$

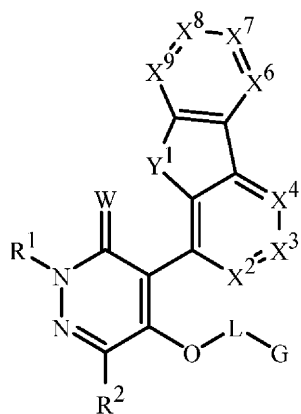
10

【 0 2 3 6 】

表 1 2 3

【 0 2 3 7 】

【化 3 7】



20

$W = O$ 、 $R^1 = CH_3$ 、 $R^2 = CH_3$ 、 $L - G = H$ 、 $Y^1 = O$ であり、残りの変数は以下に定義される。

【 0 2 3 8 】

【表 2 1】

X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>6</sup>	X <sup>7</sup>	X <sup>8</sup>	X <sup>9</sup>	
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CH	
CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	
CF	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	
CCl	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	10
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	
CH	CH	CH	CH	CH	CBr	CH	
CF	CH	CH	CH	CH	CBr	CH	
CCl	CH	CH	CH	CH	CBr	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CBr	CH	
CCH <sub>3</sub>	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	20
CCH <sub>3</sub>	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	CH	CH	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CBr	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	
CCH <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	CH	CCH <sub>3</sub>	30

【0 2 3 9】

本開示はまた、表 1 2 4 ~ 1 3 4 を含み、各表に列挙されている特定の変数は、表 1 2 3 のヘッダー行フレーズにおける対応する変数に置き換わる。例えば、表 1 2 4 のヘッダー行は、「 $W = O$ 、 $R^1 = CH_3$ 、 $R^2 = CH_3$ 、 $LG = H$ 、 $Y^1 = S$ であり、残りの変数は以下に定義される」である。

【0 2 4 0】

【表 2 2】

表	ヘッダー行変数	表	ヘッダー行変数
124	$Y^1 = S$	130	$R^2 = Cl, Y^1 = C(O)$
125	$Y^1 = NCH_3$	131	$R^2 = OCH_3$
126	$Y^1 = C(O)$	132	$R^2 = OCH_3, Y^1 = S$
127	$R^2 = Cl$	133	$R^2 = OCH_3, Y^1 = NCH_3$
128	$R^2 = Cl, Y^1 = S$	134	$R^2 = OCH_3, Y^1 = C(O)$
129	$R^2 = Cl, Y^1 = NCH_3$		

【0 2 4 1】

本発明の化合物は、一般に、組成物、すなわち、担体として機能する界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 つの追加の構成成分を有する配合物、すなわち除草性有効成分として使用される。配合物又は組成物成分は、有効成分の物理的特性、適用モード、並びに土壌タイプ、水分、及び温度などの環境要因と一致するように選択される。

## 【 0 2 4 2 】

有用な配合物としては、液体組成物及び固体組成物の両方が挙げられる。液体組成物としては、溶液（乳化性濃縮物を含む）、懸濁液、エマルジョン（マイクロエマルジョン、水中油型エマルジョン、流動性濃縮物及び／又はサスポエマルジョンを含む）などが挙げられ、任意選択的に、ゲルに増粘することができる。水性液体組成物の一般的な種類は、可溶性濃縮物、懸濁濃縮物、カプセル懸濁液、濃縮エマルジョン、マイクロエマルジョン、水中油型エマルジョン、流動性濃縮物及びサスポエマルジョンである。非水性液体組成物の一般的な種類は、乳化性濃縮物、マイクロエマルジョン性濃縮物（microemulsifiable concentrate）、分散性濃縮物、及び油分散体である。

## 【 0 2 4 3 】

固体組成物の一般的な種類は、水分散性（「湿潤性」）又は水溶性であり得る、粉塵、粉末、顆粒、ペレット、ブリル、トローチ（pastille）、錠剤、充填フィルム（シードコーティングを含む）などである。フィルム形成溶液又は流動性懸濁液から形成されるフィルム及びコーティングは、種子処理に特に有用である。有効成分は、（マイクロ）カプセル化され、懸濁液又は固形剤（solid formulation）に更に形成されてもよく、あるいは、有効成分の配合物全体をカプセル化することができる（又は「オーバーコートする」）ことができる。カプセル化は、有効成分の放出を制御又は遅延させることができる。乳化性顆粒は、乳化性濃縮物配合物及び乾燥粒状配合物の両方の利点を兼ね備えている。高強度組成物は、主に、更なる配合のための中間体として使用される。

## 【 0 2 4 4 】

噴霧可能な配合物は、典型的には、噴霧前に好適な媒体中に伸ばされる。このような液体配合物及び固形剤は、噴霧媒体中で、通常は水であるが、時に芳香族又はパラフィン系炭化水素又は植物油のような別の好適な媒体中でも容易に希釈されるように配合される。スプレー容積は、1ヘクタール当たり約1～数千リットルの範囲であり得るが、より典型的には、1ヘクタール当たり約10～数百リットルの範囲である。噴霧可能な配合物は、水、又は空中若しくは地面散布による茎葉処理のために、若しくは植物の増殖培地への適用のために好適な別の媒体とタンク混合することができる。液体及び乾燥配合物は、点滴灌漑システムに直接計量することができるか、又は植栽（planting）中に畝（furrow）中に計量することができる。

## 【 0 2 4 5 】

配合物は、典型的には、有効量の有効成分、希釈剤、及び界面活性剤を、最大100重量%を加える以下の近似範囲内に含有する。

## 【 0 2 4 6 】

## 【表 2 3】

	重量パーセント		
	活性成分	希釈剤	界面活性剤
水分散性及び水溶性顆粒、錠剤及び粉末油分散体、懸濁液、エマルジョン、溶液（乳化性濃縮物を含む）	0.001～90	0～99.999	0～15
	1～50	40～99	0～50
粉塵	1～25	70～99	0～5
顆粒及びペレット	0.001～99	5～99.999	0～15
高強度組成物	90～99	0～10	0～2

## 【 0 2 4 7 】

固体希釈剤としては、ベントナイト、モンモリロナイト、アタパルジャイト及びカオリンなどの粘度、石膏、セルロース、二酸化チタン、酸化亜鉛、デンプン、デキストリン、糖（例えば、ラクトース、スクロース）、シリカ、タルク、雲母、珪藻土、尿素、炭酸カルシウム、炭酸ナトリウム及び重炭酸ナトリウム、並びに硫酸ナトリウムが挙げられる。典型的な固体希釈剤は、Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jerseyに

記載されている。

【0248】

液体希釈剤としては、例えば、水、N,N-ジメチルアルカンアミド（例えば、N,N-ジメチルホルムアミド）、リモネン、ジメチルスルホキシド、N-アルキルピロリドン（例えば、N-メチルピロリジノン）、アルキルホスフェート（例えば、トリエチルホスフェート）、エチレングリコール、トリエチレングリコール、プロピレングリコール、ジプロピレングリコール、ポリプロピレングリコール、プロピレンカーボネート、ブチレンカーボネート、パラフィン（例えば、白色鉱油、ノルマルパラフィン、イソパラフィン）、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、グリセリン、グリセロールトリアセテート、ソルビトール、芳香族炭化水素、脱アロマ化脂肪族、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、シクロヘキサノン、2-ヘプタノン、イソホロン及び4-ヒドロキシ-4-メチル-2-ペンタノンなどのケトン、酢酸イソアミル、酢酸ヘキシル、酢酸ヘプチル、酢酸オクチル、酢酸ノニル、酢酸トリデシル、及び酢酸イソボルニルなどのアセテート、アルキル化乳酸エステル、二塩基性エステル、アルキル並びにアリールベンゾエート及びγ-ブチロラクトンなどの他のエステル、並びに直鎖、分枝鎖、飽和又は不飽和であり得る、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロピルアルコール、n-ブタノール、イソブチルアルコール、n-ヘキサノール、2-エチルヘキサノール、n-オクタノール、デカノール、イソデシルアルコール、イソオクタデカノール、セチルアルコール、ラウリルアルコール、トリデシルアルコール、オレイルアルコール、シクロヘキサノール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ジアセトンアルコール、クレゾール、及びベンジルアルコールなどのアルコールが挙げられる。液体希釈剤としては、植物種子及び果実油（例えば、オリーブ油、ヒマシ油、亜麻仁油、ゴマ油、コーン（トウモロコシ）油、ピーナッツ油、ヒマワリ油、ブドウ種子油、ペニバナ油、綿実油、大豆油、菜種油、ココナッツ油及びパーム核油）、動物起源の脂肪（例えば、牛脂、豚脂（pork tallow）、ラード、タラ肝油、魚油）、及びこれらの混合物などの飽和及び不飽和脂肪酸（典型的には、C<sub>6</sub>~C<sub>22</sub>）のグリセロールエステルも挙げられる。液体希釈剤としては、アルキル化脂肪酸（例えば、メチル化、エチル化、ブチル化）も挙げられ、脂肪酸は、植物及び動物源からのグリセロールエステルを加水分解することによって得ることができ、蒸留により精製することができる。典型的な液体希釈剤は、Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950に記載されている。

【0249】

本発明の固体及び液体組成物は、多くの場合、1つ以上の界面活性剤を含む。液体に添加されると、界面活性剤（「表面活性剤」としても知られる）は、一般に、液体の表面張力を変更させ、最も多くの場合、低減する。界面活性剤分子中の親水性基及び親油性基の性質に応じて、界面活性剤は、湿潤剤、分散剤、乳化剤、又は消泡剤として有用であり得る。

【0250】

界面活性剤は、非イオン性、アニオン性、又はカチオン性として分類することができる。本組成物に有用な非イオン性界面活性剤としては、天然及び合成アルコール（分枝状又は直鎖状であってもよい）に基づき、アルコール及びエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシド、又はこれらの混合物から調製されるアルコールアルコキシレートなどのアルコールアルコキシレート；アミンエトキシレート、アルカノールアミド、及びエトキシル化アルカノールアミド；エトキシル化大豆油、ヒマシ油、及び菜種油などのアルコキシル化トリグリセリド；オクチルフェノールエトキシレート、ノニルフェノールエトキシレート、ジノニルフェノールエトキシレート、及びドデシルフェノールエトキシレート（フェノール及びエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシド、又はこれらの混合物から調製される）などのアルキルフェノールアルコキシレート；エチレンオキシド又はプロピレンオキシドから調製されたブロックポリマー、及び末端ブロックがプロピレンオキシドから調製される逆ブロックポリマー（reverse block polymer）



；エトキシ化脂肪酸；エトキシ化脂肪酸エステル及び油；エトキシ化メチルエステル；エトキシ化トリステアールフェノール（エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシド、又はこれらの混合物から調製されるものを含む）；脂肪酸エステル、グリセロールエステル、ラノリン系誘導体、ポリエトキシレートエステル、例えば、ポリエトキシ化ソルビタン脂肪酸エステル、ポリエトキシ化ソルビトール脂肪酸エステル、及びポリエトキシ化グリセロール脂肪酸エステル；ソルビタンエステルなどの他のソルビタン誘導体；ランダムコポリマー、ブロックコポリマー、アルキド p e g（ポリエチレングリコール）樹脂、グラフト又は櫛状ポリマー（comb polymer）及び星形ポリマー（star polymer）などのポリマー界面活性剤；ポリエチレングリコール（p e g）；ポリエチレングリコール脂肪酸エステル；シリコン系界面活性剤；並びにスクロースエステル、アルキルポリグリコシド、及びアルキル多糖類などの糖誘導体が挙げられるが、これらに限定されない。

10

#### 【 0 2 5 1 】

有用なアニオン性界面活性剤としては、アルキルアリアルスルホン酸及びその塩；カルボキシ化アルコール又はアルキルフェノールエトキシレート；ジフェニルスルホネート誘導体；リグノスルホネートなどのリグニン及びリグニン誘導体；マレイン酸又はコハク酸若しくはそれらの無水物；オレフィンスルホネート；アルコールアルコキシレートのリン酸エステル、アルキルフェノールアルコキシレートのリン酸エステル、及びスチリルフェノールエトキシレートのリン酸エステルなどのリン酸エステル；タンパク質系界面活性剤；サルコシン誘導体；スチリルフェノールエーテルスルフェート；油及び脂肪酸のスルフェート及びスルホネート；エトキシ化アルキルフェノールのスルフェート及びスルホネート；アルコールのスルフェート；エトキシ化アルコールのスルフェート；N，N - アルキルタウレートなどのアミン及びアミドのスルホネート；ベンゼン、クメン、トルエン、キシレン、及びドデシル並びにトリデシルベンゼンのスルホネート；縮合ナフタレンのスルホネート；ナフタレン及びアルキルナフタレンのスルホネート；分留石油のスルホネート；スルホサクシナメート；及びスルホサクシネート並びにジアルキルスルホコハク酸塩などのそれらの誘導体が挙げられるが、これらに限定されない。

20

#### 【 0 2 5 2 】

有用なカチオン性界面活性剤としては、アミド及びエトキシ化アミド；N - アルキルプロパンジアミン、トリプロピレントリアミン及びジプロピレントトラミンなどのアミン、並びにエトキシ化アミン、エトキシ化ジアミン及びプロボキシ化アミン（アミン及びエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシド、又はこれらの混合物から調製される）；アミンアセテート及びジアミン塩などのアミン塩；四級塩、エトキシ化四級塩及びジ四級塩などの第四級アンモニウム塩；並びにアルキルジメチルアミノオキシド及びビス - （2 - ヒドロキシエチル） - アルキルアミノオキシドなどのアミノオキシドが挙げられるが、これらに限定されない。

30

#### 【 0 2 5 3 】

また、本組成物に有用なものは、非イオン性及びアニオン性界面活性剤の混合物、又は非イオン性及びカチオン性界面活性剤の混合物である。非イオン性、アニオン性及びカチオン性界面活性剤、並びにそれらの推奨される用途は、McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, annual American and International Editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; 及び A. S. Davidson and B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987 を含む様々な公開された参考文献に記載されている。

40

50

## 【0254】

本発明の組成物はまた、配合補助剤 (formulation aid) として当業者に既知の配合補助剤 (formulation auxiliaries) 及び添加剤を含有してもよい (その一部は、固体希釈剤、液体希釈剤、又は界面活性剤としても機能すると考えられ得る)。このような配合補助剤及び添加剤は、pH (緩衝剤)、加工中の発泡 (ポリオルガノシロキサンなどの消泡剤)、有効成分の沈降 (懸濁剤)、粘度 (チキソトロピック増粘剤)、容器内の細菌増殖 (抗菌剤)、生成物の凍結 (不凍剤)、色 (染料 / 顔料分散液)、洗い流し (wash-off) (被膜形成剤又はステッカー)、蒸発 (蒸発遅延剤 (evaporation retardant))、及び他の配合属性 (formulation attribute) を防除することができる。被膜形成剤としては、例えば、ポリビニルアセテート、ポリビニルアセテートコポリマー、ポリビニルピロリドン - ビニルアセテートコポリマー、ポリビニルアルコール、ポリビニルアルコールコポリマー及びワックスが挙げられる。配合補助剤及び添加剤の例としては、McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, annual International and North American editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; 及びPCT公開第03/024222号に列挙されているものが挙げられる。

10

## 【0255】

式1の化合物及び任意の他の有効成分は、典型的には、有効成分を溶媒に溶解することによって、又は液体若しくは乾燥希釈剤中で粉碎することによって、本組成物に組み込まれる。乳化性濃縮物を含む溶液は、単に成分を混合することによって調製することができる。乳化性濃縮物として使用するために意図される液体組成物の溶媒が水不混和性である場合、乳化剤は、典型的には、水で希釈した際に活性物含有溶媒 (active-containing solvent) を乳化するために添加される。最大2,000 µmの粒径を有する有効成分スラリーを、メディアミル (media mill) を使用してウェットミリングして、3 µm未満の平均直径を有する粒子を得ることができる。水性スラリーは、最終懸濁濃縮物 (例えば、米国特許第3,060,084号を参照されたい) に作製することができ、又は更に噴霧乾燥によって処理して、水分散性顆粒を形成することができる。乾燥配合物は、通常、2 ~ 10 µmの範囲の平均粒径をもたらす乾式粉碎プロセス (dry milling process) を必要とする。粉塵及び粉末は、ブレンダー及び (ハンマーミル又は流体エネルギーミルを用いる) 通常粉碎することによって調製することができる。顆粒及びペレットは、予め形成された顆粒担体上に、又は凝集技術によって活性物質を噴霧することによって調製することができる。Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp 147 - 48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, 頁8 - 57及び以降、並びにWO 91/13546を参照されたい。ペレットは、米国特許第4,172,714号に記載されるように調製することができる。水分散性及び水溶性顆粒は、米国特許第4,144,050号、米国特許第3,920,442号及び独国特許第3,246,493号に教示されているように調製することができる。錠剤は、米国特許第5,180,587号、米国特許第5,232,701号及び米国特許第5,208,030号に教示されているように調製することができる。フィルムは、英国特許第2,095,558号及び米国特許第3,299,566号に教示されるように調製することができる。

20

30

40

## 【0256】

配合の技術に関する更なる情報については、T.S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" in Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks and T.R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress

50

on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120 - 133を参照されたい。また、米国特許第3,235,361号、6欄、16行～7欄、19行及び実施例10～41；米国特許第3,309,192号、5欄、43行～7欄、62行、及び実施例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138～140、162～164、166、167及び169～182；米国特許第2,891,855号、3欄、66行～5欄、17行及び実施例1～4；Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc, New York, 1961, 81-96；Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989；及び Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000も参照されたい。

10

## 【0257】

以下の実施例では、全ての百分率は重量によるものであり、全ての配合物は従来の方法で調製される。化合物番号は、索引表Aの化合物を指す。更なる説明なしに、先行する説明を用いる当業者は、本発明を最大限に活用することが可能であると考えられている。それ故、以下の実施例は単なる例示として解釈されるべきであり、本開示を他のいかなる方法で限定するものではない。百分率は、別途記載のない限り重量によるものである。

## 【0258】

20

## 【表24】

## 実施例A

高強度濃縮物

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

## 【0259】

## 【表25】

## 実施例B

湿潤性粉末

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

30

## 【0260】

## 【表26】

## 実施例C

顆粒

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

40

## 【0261】

## 【表 27】

## 実施例 D

押出ペレット

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

## 【0262】

## 【表 28】

10

## 実施例 E

乳化性濃縮物

化合物 1	10.0%
ポリオキシエチレンソルビトールヘキサオレエート	20.0%
C <sub>6</sub> ～C <sub>10</sub> 脂肪酸メチルエステル	70.0%

## 【0263】

## 【表 29】

## 実施例 F

マイクロエマルジョン

化合物 1	5.0%	20
ポリビニルピロリドンービニルアセテートコポリマー	30.0%	
アルキルポリグリコシド	30.0%	
グリセリルモノオレエート	15.0%	
水	20.0%	

## 【0264】

## 【表 30】

## 実施例 G

懸濁濃縮物

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

## 【0265】

## 【表 31】

## 実施例 H

水中エマルジョン

40

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

## 【0266】

50

## 【表 3 2】

## 実施例 I

## 油分散体

化合物 1	25%
ポリオキシエチレンソルビタンヘキサオレート	15%
有機変性ベントナイト粘土	2.5%
脂肪酸メチルエステル	57.5%

## 【0 2 6 7】

本開示はまた、「化合物 1」が「化合物 2」、「化合物 3」、「化合物 4」、「化合物 5」、「化合物 6」、「化合物 7」、「化合物 8」、「化合物 9」又は「化合物 10」と置換されていることを除き、上記実施例 A ~ I を含む。

10

## 【0 2 6 8】

試験結果は、本発明の化合物が、非常に活性な発芽前施用並びに / 又は発芽後施用除草剤及び / 若しくは植物成長調整剤であることを示す。本発明の化合物は、一般的に、発芽後防除（すなわち、雑草実生が土壌から現れた後に適用される）、及び発芽前防除（すなわち、雑草実生が土壌から現れる前に適用される）に対して最も高い活性を示す。これらの多くは、燃料貯蔵タンク、産業用貯蔵エリア、駐車場、ドライブインシアター、飛行場、河岸、灌漑及び他の水路の周囲、看板及び高速道路並びに鉄道構造物の周囲など、全ての植生の完全な防除が所望される領域において、広域範囲の発芽前及び / 又は発芽後の雑草防除に有用である。本発明の化合物の多くは、作物対雑草における選択的代謝により、又は作物及び雑草における生理的阻害場所における選択的活性によって、又は作物と雑草が混ざった環境上若しくは環境内での選択的な配置によって、作物 / 雑草の混在内のイネ科雑草及び広葉雑草の選択的防除に有用である。当業者であれば、化合物又は化合物群内のこれらの選択性因子の好ましい組み合わせは、日常的な生物学的及び / 又は生化学的アッセイを行うことによって容易に測定することができることを認識するであろう。本発明の化合物は、アルファルファ、大麦、綿、小麦、セイヨウアブラナ、サトウダイコン、コーン（トウモロコシ）、ソルガム、大豆、コメ、オート麦、ピーナッツ、野菜、トマト、ジャガイモ、コーヒー、ココア、油パーム、ゴム、サトウキビ、柑橘、ブドウ、果樹、堅実樹、バナナ、プランテン（plantain）、パイナップル、ホップ、紅茶及びユーカリノキ及び球果植物（例えば、ロブローリーパイン）を含む森林などの多年生のプランテーション作物、及び芝種（例えば、ナガハグサ（Kentucky bluegrass）、セントオーガスチングラス（St. Augustine grass）、オニウシノケグサ（Kentucky fescue）及びギョウギンバ（Bermuda grass））が挙げられるが、これらに限定されない重要な農作物に対する耐性を示し得る。本発明の化合物は、遺伝的に形質転換し、交配して除草剤に対する耐性を組み込み、無脊椎害虫に対してタンパク質毒素（例えば、パチルス・チューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）毒素など）を発現することができ、及び / 又は他の有用な形質を発現する作物を使用することができる。当業者であれば、全ての化合物が全ての雑草に対して均等に有効ではないことを理解するであろう。あるいは、対象化合物は、植物の成長を調節するのに有用である。

20

30

## 【0 2 6 9】

本発明の化合物は出芽前及び出芽後の両方の除草剤活性を有して植生を殺傷又は損傷することによって又はその成長を低減させることにより望ましくない植生を防除するので、当該化合物は、除草性有効量の本発明の化合物、又は当該化合物と、界面活性剤、固体希釈剤若しくは液体希釈剤のうちの少なくとも 1 つと含む組成物を、望ましくない植生の群衆若しくは他の部分、又は望ましくない植生が成長している土壌若しくは水、望ましくない植生の種子若しくは他の栄養分体を取り囲む土壌若しくは水などの望ましくない植生の環境に接触させることを伴う様々な方法によって有効に適用することができる。望ましくない植生は、イネ科雑草及び広葉雑草からなる群から選択される少なくとも 1 つを含む。望ましくない植生は、ススメノカタピラ（annual bluegrass）、マルバツユクサ（Benghal dayflower）、ノスズメノテッポウ（blackgrass）、イヌホウズキ（black nightshad

40

50

e)、メリケンニクキビ(broadleaf signalgrass)、セイヨウトゲアザミ(Canada thistle)、カラスノチャヒキ(cheat)、オナモミ(common cocklebur)(Xanthium pensylvanicum)、ブタクサ(common ragweed)、ヒナゲシ(corn poppies)、マキバスマレ(field violet)、アキノエノコログサ(giant foxtail)、オヒシバ(goosegrass)、エノコログサ(green foxtail)、ギニアグラス(guinea grass)、コセンダングサ(hairy beggarticks)、除草剤耐性ノスズメノテッポウ(herbicide-resistant black grass)、ヒメムカシヨモギ(horseweed)、イタリアンライグラス(Italian rye grass)、シロバナチョウセンアサガオ(jimsonweed)、セイバンモロコシ(Johnson grass)(Sorghum halense)、オニメヒシバ(large crabgrass)、リトルシードカナリーグラス(little seeded canary grass)、アサガオ(morning glory)、ペンシルバニアヤナギタデ(Pennsylvania smartweed)、マメアサガオ(pitted morning glory)、プリクリシダ(prickly sida)、シバムギ(quackgrass)、アオゲイトウ(redroot pigweed)、シャッターケイン(shattercane)、ナズナ(shepherd's purse)、シルキーウィンドグラス(silky windgrass)、ヒマワリ(ジャガイモの雑草として)、ソバカズラ(wild buckwheat)(Polygonum convolvulus)、ノハラガラシ(wild mustard)(Brassica kaber)、カラスムギ(wild oat)(Avena fatua)、ショウジョウソウ(wild pointsettia)、キンエノコロ(yellow foxtail)、及びショクヨウガヤツリ(yellow nutsedge)(Cyperus esculentus)からなる群から選択される。

#### 【0270】

本発明の化合物の除草性有効量は、多数の因子によって決定される。これらの因子としては、選択される配合物、適用方法、存在する植生の量及び種類、成長条件などが挙げられる。一般に、本発明の化合物の除草性有効量は、約0.001~20kg/haであり、好ましくは約0.004~1kg/haの範囲である。当業者は、所望のレベルの雑草防除に必要な除草性有効量を容易に決定することができる。

#### 【0271】

一般的な一実施形態では、本発明の化合物は、典型的には配合された組成物において、所望の植物(例えば、作物)及び望ましくない植生(すなわち、雑草)を含む場所に適用され、これらの両方は、成長媒体(growth medium)(例えば、土壌)と接触する、種子、実生植物、及び/又はより大きな植物であってもよい。この場所において、本発明の化合物を含む組成物は、植物又はその一部、特に望ましくない植生、及び/又は植物と接触する成長媒体に直接適用することができる。

#### 【0272】

最も典型的には、本発明の化合物は、望ましくない植生を防除するために使用されるが、処理された場所における所望の植生の本発明の化合物との接触は、遺伝子修飾を介して組み込まれた形質を含む、所望の植生における遺伝形質との超相加的又は増強された効果(super-additive or enhanced effects)をもたらす得る。例えば、植物性害虫又は植物病害に対する耐性、生物学的/非生物学的ストレス又は貯蔵安定性に対する耐性は、所望の植生における遺伝形質から予想されるものよりも大きくてもよい。

#### 【0273】

本発明の化合物はまた、除草剤、除草剤毒性緩和剤、殺真菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、殺菌剤、ダニ駆除剤、昆虫脱皮阻害剤(insect molting inhibitor)及び発根刺激剤(rooting stimulant)などの成長調節因子(growth regulator)、化学不妊化剤、セミオケミカルズ(semiochemicals)、忌避剤、誘引剤、フェロモン、刺激剤(feeding stimulant)、植物栄養素、他の生物学的活性化合物又は昆虫病原性細菌(entomopathogenic bacteria)、ウイルス又は真菌を含む1つ以上の生物学的活性化合物若しくは作用物質(agent)と混合して、更なる広域範囲の農業的な防御をもたらす他成分殺虫剤(multi-component pesticide)を形成することができる。本発明の化合物と他の除草剤との混合物は、追加の雑草種に対する活性の範囲を広げることができ、任意の抵抗性バイオタイプの増殖を抑制することができる。したがって、本発明はまた、式1の化合物(除草性有効量で)と、少なくとも1つの追加の生物学的活性化合物又は作用物質(生物学的有効量で)を

含む組成物にも関し、界面活性剤、固体希釈剤又は液体希釈剤のうちの少なくとも1つを更に含むことができる。他の生物学的活性化合物又は作用物質は、界面活性剤、固体又は液体希釈剤のうちの少なくとも1つを含む組成物中に配合することができる。本発明の混合物の場合、1つ以上の他の生物学的活性化合物又は作用物質を、式1の化合物と一緒に配合して、プレミックスを形成することができるか、又は1つ以上の他の生物学的活性化合物又は作用物質は、式1の化合物とは別に配合することができ、配合物は、適用前に一緒に合わせることができ（例えば、スプレータンク内で）、あるいは連続して適用することができる。

#### 【0274】

以下の除草剤のうちの1つ以上と本発明の化合物との混合物は、雑草防除のために特に有用であり得る：アセトクロール、アシフルオルフェン及びそのナトリウム塩、アクロニフェン、アクロレイン（2-プロペナール）、アラクロール、アロキシジム、アメトリン、アミカルバゾン、アミドスルフロン、アミノシクロピラクロル（aminocyclopyrachlor）及びそのエステル（例えば、メチル、エチル）及び塩（例えば、ナトリウム、カリウム）、アミノピラリド、アミトロール、スルファミン酸アンモニウム、アニロホス、アスラム、アトラジン、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、ベンカルバゾン、ベンフルラリン、ベンフレセート、ベンスルフロン-メチル、ベンスリド、ベントラジン、ベンゾピシクロン、ベンゾフェナップ、ピシクロピロン、ピフェノックス、ピラナホス、ビスピリバック及びそのナトリウム塩、プロマシル、プロモブチド、プロモフェノキシム、プロモキシニル、オクタン酸プロモキシニル、ブタクロール、ブタフェナシル、ブタミホス、ブトラリン、ブトロキシジム、ブチレート、カフェンストロール、カルベタミド、カルフェントラゾン-エチル、カテキン、クロメトキシフェン、クロラムベン、クロルプロムロン、クロルフルレノール-メチル（chlorflurenol-methyl）、クロリダゾン、クロリムロン-エチル、クロロトルロン、クロルプロファム、クロルスルフロン、クロルタール-ジメチル、クロルチアミド、シニドン-エチル、シンメチリン、シノスルフロン、クラシホス、クレホキシジム（clefoxydim）、クレトジム（clethodim）、クロジナホップ-プロパルギル、クロマゾン、クロメプロップ、クロピラリド、クロピラリド-オラミン、クロランスラム-メチル、クミルロン、シアナジン、シクロエート、シクロピリモレート、シクロスルファムロン、シクロキシジム、シハロホップ-ブチル、2,4-D及びそのブチル、ブチル、イソオクチル及びイソプロピルエステル及びそのジメチルアンモニウム、ジオラミン及びトロールアミン塩（trolamine salt）、ダイムロン、ダラボン、ダラボン-ナトリウム、ダゾメット、2,4-DB及びそのジメチルアンモニウム、カリウム及びナトリウム塩、デスメディファム（desmedipham）、デスメトリン、ジカンバ及びそのジグリコールアンモニウム、ジメチルアンモニウム、カリウム及びナトリウム塩、ジクロベニル、ジクロルプロップ、ジクロホップ-メチル、ジクロスラム、ジフェンゾコートメチルスルフェート（difenzoquat metilsulfate）、ジフルヘニカン、ジフルフェンゾピル、ジメフロン、ジメピペレート、ジメタクロール、ジメタトリン、ジメテナミド、ジメテナミド-P（dimethenamid-P）、ジメチピン、ジメチルアルシン酸（dimethylarsinic acid）及びそのナトリウム塩、ジニトロアミン（dinitramine）、ジノテルブ、ジフェナミド、ジクワットジブロミド（diquat dibromide）、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、エタメットフロン-メチル、エチオジン、エトフメセート、エトキシフェン、エトキシスルフロン、エトベンザニド、フェノキサプロップ-エチル、フェノキサプロップ-P-エチル、フェノキサスルホン、フェンキノトリオン、フェントラザミド、フェヌロン、フェヌロン-TCA、フラムプロップ-メチル（flamprop-methyl）、フラムプロップ-M-イソプロピル、フラムプロップ-M-メチル、フラザスルフロン、フロラスラム、フルアジホップ-ブチル（fluzifop-butyl）、フルアジホップ-P-ブチル（fluzifop-P-butyl）、フルアゾレート、フルカルバゾン、フルセトスルフロン、フルクロラリン（fluchloralin）、フルフェナセート、フルフェンピル（flufenpyr）、フルフェンピル-エチル、フルメツラム、フルミクロラック-ペンチル、フルミオキサジン、フルオメツロン、フ

10

20

30

40

50

ルオログリコフェン - エチル、フルボキサム、フルピルスルフロ - メチル及びそのナトリウム塩、フルレノール、フルレノール - ブチル、フルリドン、フルロクロリドン、フルロキシビル、フルルタモン、フルチアセット - メチル、ホメサフェン、ホラムスルフロ - ホサミン - アンモニウム、グルホシネート、グルホシネート - アンモニウム、グルホシネート - P、例えばアンモニウム、イソプロビルアンモニウム、カリウム、ナトリウム（セスキナトリウム塩を含む）及びトリメシウム塩（又は、スルホサートと呼ばれる）などのグリホサート及びその塩、ハラウキシフェン、ハラウキシフェン - メチル、ハロスルフロ - メチル、ハロキシホップ - エトチル（haloxyfop-etotyl）、ハロキシホップ - メチル（haloxyfop-methyl）、ヘキサジノン、ヒダントシジン、イマザメタベンズ - メチル、イマザモックス、イマザピック、イマザピル、イマザキン、イマザキン - アンモニウム、イマゼタピル、イマゼタピル - アンモニウム、イマゾスルフロ、インダノファン、インダジフラム、イオフェンスルフロ（iofensulfuron）、ヨードスルフロ - メチル、イオキシニル、イオキシニルオクタノエート、イオキシニル - ナトリウム、イプフェンカルバゾン、イソプロツロン（isoproturon）、イソウロン、イソキサベン、イソキサフルトール、イソキサクロルトール、ラクトフェン、レナシル、リニューロン、マレイン酸ヒドラジド、MCPA及びその塩（例えば、MCPA - ジメチルアンモニウム、MCPA - カリウム及びMCPA - ナトリウム、エステル（例えば、MCPA - 2 - エチルヘキシル、MCPA - ブトチル）及びチオエステル（例えば、MCPA - チオエチル）、MCPB及びその塩（例えば、MCPB - ナトリウム）及びエステル（例えば、MCPB - エチル）、メコプロップ、メコプロップ - P、メフェナセット（mefenacet）、メフルイジド、メソスルフロ - メチル、メソトリオン、メタム - ナトリウム、メタミホブ（metamifop）、メタミトロン、メタザクロール、メタゾスルフロ、メタベンズチアズロン、メチルアルソン酸及びそのカルシウム、モノアンモニウム、モノナトリウム及びジナトリウム塩、メチルダイムロン、メトベンズロン、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、メトキスロン、メトリブジン、メトスルフロ - メチル、モリネート、モノリニューロン、ナプロアニリド、ナプロパミド、ナプロパミド - M、ナブタラム、ネブロン、ニコスルフロ、ノルフラゾン、オルベンカルブ（orbencarb）、オルトスルファムロン、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、オキサジクロメホン（oxaziclomefone）、オキシフルオルフェン、パラクアットジクロリド（paraquat dichloride）、ペブレート、ペラルゴン酸、ペンディメタリン（pendimethalin）、ペノキススラム（penoxsulam）、ペントノクロル、ペントキサゾン、パーフルイドン（perfluidone）、ペトキサミド、ペソキシアミド（pethoxamid）、フェンメディファム（phenmedipham）、ピクロラム、ピクロラム - カリウム、ピコリナフェン、ピノキサデン、ピペロホス、プレチラクロー、プリミスルフロ - メチル、プロジアミン、プロホキシジム、プロメトン、プロメトリン、プロパクロール、プロパニル、プロパキサホップ（propaquizafop）、プロバジン、プロファム、プロビスクロール、プロボキシカルバゾン、プロピルスルフロ、プロピザミド、プロスルホカルブ（prosulfocarb）、プロスルフロ、ピラクロニル、ピラフルフェン - エチル、ピラスルホトール（pyrasulfotole）、ピラゾギル（pyrazogyl）、ピラゾリネート、ピラゾキシフェン、ピラゾスルフロ - エチル、ピリベンゾキシム、ピリブチカルブ（pyributicarb）、ピリデート、ピリフタリド、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（pyroxsulam）、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 - エチル（quizalofop-ethyl）、キザロホップ - P - エチル（quizalofop-P-ethyl）、キザロホップ - P - テフリル（quizalofop-P-tefuryl）、リムスルフロ、サフルフェナシル、セトキシジム、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 - メチル、スルホスルフロ、2, 3, 6 - TBA、TCA、TCA - ナトリウム、テブタム、テブチウロン、テフリルトリオン、テンボトリオン、テブラロキシジム、ターバシル、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、チフェンスルフロ - メチル、チオベンカルブ（thiobencarb）、チアフェナシル、チオカルバジル、トル

10

20

30

40

50



ピラレート、トブラメゾン、トラルコキシジム、トリ - アレート、トリアファモネ (triafamone)、トリアスルフロン、トリアジフラム、トリベニユロン - メチル、トリクロピル、トリクロピル - ブトチル、トリクロピル - トリエチルアンモニウム、トリジファン、トリエタジン、トリフロキシスルフロン、トリフルジモキサジン、トリフルラリン、トリフルスルフロン - メチル、トリトスルフロン、ベルノレート、3 - (2 - クロロ - 3, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 1, 5 - ナフチリジン - 2 (1 H) - オン、5 - クロロ - 3 - [ (2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル) カルボニル] - 1 - (4 - メトキシフェニル) - 2 (1 H) - キノキサリノン、2 - クロロ - N - (1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジンカルボキサミド、7 - (3, 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 5 - (2, 2 - ジフルオロエチル) - 8 - ヒドロキシピリド [2, 3 - b] ピラジン - 6 (5 - H) - オン、4 - (2, 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノン、5 - [ [ (2, 6 - ジフルオロフェニル) メトキシ] メチル] - 4, 5 - ジヒドロ - 5 - メチル - 3 - (3 - メチル - 2 - チエニル) イソキサゾール (以前は、メチオキソリン (methioxolin))、4 - (4 - フルオロフェニル) - 6 - [ (2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル) カルボニル] - 2 - メチル - 1, 2, 4 - トリアジン - 3, 5 - (2 H, 4 H) - ジオン、メチル 4 - アミノ - 3 - クロロ - 6 - (4 - クロロ - 2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) - 5 - フルオロ - 2 - ピリジンカルボキシレート、2 - メチル - 3 - (メチルスルホニル) - N - (1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、及び 2 - メチル - N - (4 - メチル - 1, 2, 5 - オキサジアゾール - 3 - イル) - 3 - (メチルスルフィニル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド。他の除草剤としてはまた、例えばアルテルナリア・デストルエンズ・シモンズ (Alternaria destruens Simmons)、コレトリカム・グロエオスポリオデス (Colletotrichum gloeosporioides (Penz.) Penz. & Sacc.)、ドレキシエラ・モノセラス (Drechslera monoceras) (MTB - 951)、ミロテシウムベルカリア (Myrothecium verrucaria (Albertini & Schweinitz) Ditmar: Fries)、フィトフトラ・パルミボラ (Phytophthora palmivora (Butl.) Butl.) 及びプッチニア・ツラスペオス・シュブ (Puccinia thlaspeos Schub) などの生物除草剤が含まれる。

【0275】

望ましくない植生のより良好な防除 (例えば、増強された効果、より広範な範囲の雑草防除、又は強化された作物安全性などの使用率の低下) のためには、又は抵抗性雑草の発生を防止するためには、本発明の化合物と、アトラジン、アジムスルフロン、S - ベフルブタミド、ベンズイソチアゾリノン、カルフェントラゾン - エチル、クロリムロン - エチル、クロルスルフロン - メチル、クロマゾン、クロピラリドカリウム、クロランスラム - メチル、2 - [ (2, 4 - ジクロロフェニル) メチル] - 4, 4 - ジメチル - 3 - イソオキサゾリジノン、2 - [ (2, 5 - ジクロロフェニル) メチル] - 4, 4 - ジメチル - 3 - イソオキサゾリジノン、エタメットフロン - メチル、フルメツラム、4 - (4 - フルオロフェニル) - 6 - [ (2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル) カルボニル] - 2 - メチル - 1, 2, 4 - トリアジン - 3, 5 - (2 H, 4 H) - ジオン、フルビルスルフロン - メチル、フルチアセット - メチル、ホメサフェン、イマゼタピル、レナシル、メソトリオン、メトリブジン、メツルフロンメチル、ペトキサミド、ピクロラム、ピロキサスルホン、キンクロラック、リムスルフロン、S - メトラクロール、スルフェントラゾン、チフェンスルフロン - メチル、トリフルスルフロン - メチル、及びトリベニユロン - メチルからなる群から選択される除草剤との混合物が好ましい。

【0276】

本発明の化合物はまた、例えばアビグリシン、N - (フェニルメチル) - 1 H - プリン - 6 - アミン、エポコレオン、ジベレリン酸、ジベレリン A<sub>4</sub> 及び A<sub>7</sub>、ハーピンタン

パク質、メピコートクロリド、プロヘキサジオンカルシウム、プロヒドロジャスモン、ナトリウムニトロフェノレート及びトリネキサバック - メチルなどの植物成長調節因子と、バチルス・セレウス (*Bacillus cereus*) 菌株 B P 0 1 などの植物成長調節微生物 (plant growth modifying organisms) と組み合わせて使用することもできる。

【 0 2 7 7 】

農業保護剤 (すなわち、除草剤、除草剤毒性緩和剤、殺虫剤、殺真菌剤、殺線虫剤、ダニ駆除剤及び生物学的作用物質) に関する一般的な文献には、The Pesticide Manual, 13th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U. K., 2003 及び The BioPesticide Manual, 2nd Edition, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U. K., 2001 が含まれる。

【 0 2 7 8 】

これらの様々な混合パートナーのうちの 1 つ以上が使用される実施形態では、混合パートナーは、典型的には、混合パートナーが単独で使用されるときに慣習的な量と同様の量で使用される。より具体的には、混合物において、有効成分は、多くの場合、有効成分のみを使用するための製品ラベル上で明記された半散布量と全散布量との間の散布量 (application rate) で適用される。これらの量は、例えば The Pesticide Manual 及び The BioPesticide Manual などの参考文献に列挙されている。これらの様々な混合パートナー (総計で) 対式 1 の化合物の重量比は、典型的には約 1 : 3000 ~ 約 3000 : 1 である。注目すべきは、約 1 : 300 ~ 約 300 : 1 の重量比 (例えば、約 1 : 30 ~ 約 30 : 1 の比) である。当業者であれば、所望の範囲の生物学的活性に必要とされる有効成分の生物学的有効量を単純な実験を通して容易に決定することができよう。これらの追加の構成成分を包含することが、防除される雑草の範囲を式 1 の化合物単独で防除される範囲を超えて拡大できることは明らかであろう。

【 0 2 7 9 】

特定の例では、本発明の化合物と他の生物学的に活性な (特に除草性の) 化合物又は作用物質 (すなわち、有効成分) との組み合わせは、雑草に対して相加的を上回る (すなわち増強した) 効果をもたらす、及び/又は、作物若しくは他の望ましい植物に対して相加的を上回らない (すなわち、毒性緩和 (safening)) 効果を生じさせることができる。効果的な有害虫の防除を確実にしながら環境中に放出される有効成分の量を低減させることは、常に望ましい。過剰な作物被害を伴うことなくより効果的な雑草防除を提供するためにより多量の有効成分を使用できる能力もまた望ましい。雑草に対する除草剤混合物の有効成分の増強効果が農業経済学的に満足できるレベルの雑草防除をもたらす散布量で発生する場合、そのような組み合わせは、作物生産コストの削減及び環境負荷の低減に有利な可能性がある。作物への除草性有効成分の毒性緩和が発生する場合、そのような組み合わせは、雑草競合を減少させることによって作物保護を高めるのに有利な可能性がある。

【 0 2 8 0 】

注目すべきは、本発明の化合物と少なくとも 1 つの他の除草性有効成分との組み合わせである。特に注目すべきは、他の除草性有効成分が本発明の化合物とは異なる作用部位 (site of action) を有するような組み合わせである。特定の例では、類似の防除範囲を有するが作用部位が異なる少なくとも 1 つの他の除草性有効成分との組み合わせが、抵抗性管理にとって特に有利であろう。したがって、本発明の組成物は、類似の防除範囲を有するが作用部位が異なる少なくとも 1 つの追加の除草性有効成分を (除草性有効量で) 更に含むことができる。

【 0 2 8 1 】

特定の作物にとっての安全性を高めるために、例えばアリドクロル (allidochlor)、ペノキサコール、クロキントセット - メキシル、クミルロン、シオメトリニル、シプロスルホンアミド、ダイムロン、ジクロルミド、ジシクロノン、ジエトレート、ジメビペレ

ート、フェンクロラゾール - エチル、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン - エチル、メフェンピル - ジエチル、メフェネート、メトキシフェノン、ナフタル酸無水物 ( 1 , 8 - ナフタル酸無水物 )、オキサベトリニル、N - ( アミノカルボニル ) - 2 - メチルベンゼンスルホンアミド、N - ( アミノカルボニル ) - 2 - フルオロベンゼンスルホンアミド、1 - ブロモ - 4 - [ ( クロロメチル ) スルホニル ] ベンゼン ( B C S )、4 - ( ジクロロアセチル ) - 1 - オキサ - 4 - アゾスピロ [ 4 . 5 ] デカン ( M O N 4 6 6 0 )、2 - ( ジクロロメチル ) - 2 - メチル - 1 , 3 - ジオキサラン ( M G 1 9 1 )、エチル 1 , 6 - ジヒドロ - 1 - ( 2 - メトキシフェニル ) - 6 - オキソ - 2 - フェニル - 5 - ピリミジンカルボキシレート、2 - ヒドロキシ - N , N - ジメチル - 6 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド、並びに 3 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル 1 - ( 3 , 4 - ジメチルフェニル ) - 1 , 6 - ジヒドロ - 6 - オキソ - 2 - フェニル - 5 - ピリミジンカルボキシレート、2 , 2 - ジクロロ - 1 - ( 2 , 2 , 5 - トリメチル - 3 - オキサゾリジニル ) - エタノン及び 2 - メトキシ - N - [ [ 4 - [ ( メチルアミノ ) カルボニル ] アミノ ] フェニル ] スルホニル ] - ベンズアミドなどの除草剤毒性緩和剤と組み合わせて使用することができる。解毒性有効量の除草剤毒性緩和剤は、本発明の化合物と同時に適用できるか、又は種子処理として適用できる。したがって、本発明の一態様は、本発明の化合物及び解毒性有効量 ( antitotally effective amount ) の除草剤毒性緩和剤を含む除草剤混合物に関する。種子処理は、それが解毒を作物植物に物理的に限定するので、選択的な雑草防除にとって特に有用である。したがって、本発明の特に有用な実施形態は、作物における望ましくない植生の成長を選択的に防除する方法であって、作物の場所を除草性有効量の本発明の化合物と接触させることを含み、このときそれから作物が成長する種子が解毒性有効量の毒性緩和剤を用いて処理される方法である。毒性緩和剤の解毒性有効量は、当業者であれば単純な実験を通して容易に決定できよう。

#### 【 0 2 8 2 】

本発明の化合物はまた、( 1 ) 除草効果をもたらす遺伝子由来転写のダウンレギュレーション、干渉、抑制若しくはサイレンシングを通して特定標的の量に影響を及ぼす DNA、RNA 及び / 又は化学修飾ヌクレオチドを含むがこれらに限定されないポリヌクレオチド；又は ( 2 ) 毒性緩和効果をもたらす遺伝子由来転写のダウンレギュレーション、干渉、抑制若しくはサイレンシングを通して特定標的の量に影響を及ぼす DNA、RNA 及び / 又は化学修飾ヌクレオチドを含むがこれらに限定されないポリヌクレオチドと混合することができる。

#### 【 0 2 8 3 】

注目すべきは、本発明の ( 除草性有効量にある ) 化合物と、他の ( 有効量にある ) 除草剤及び除草剤毒性緩和剤からなる群から選択される少なくとも 1 つの追加の有効成分と、界面活性剤、固体希釈剤及び液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 つの構成成分とを含む組成物である。

#### 【 0 2 8 4 】

望ましくない植生のより良好な防除 ( 例えば、増強された効果、より広範な範囲の雑草防除、又は強化された作物安全性などの使用率の低下 ) のために、又は抵抗性雑草の発生を防止するためには、本発明の化合物と、クロリムロン - エチル、ニコスルフロン、メソトリオン、チフェンスルフロン - メチル、フルピルスルフロン - メチル、トリベニュロン、ピロキサスルホン、ピノキサデン、テンボトリオン、ピロキシスラム、メトラクロール、及び S - メトラクロールからなる群から選択される除草剤との混合物が好ましい。

#### 【 0 2 8 5 】

以下の試験は、特定の雑草に対する本発明の化合物の防除有効性を証明する。しかしながら、これらの化合物によって与えられる雑草防除は、これらの種に限定されるものではない。化合物の説明については、索引表 A を参照されたい。以下の略語は、以下の索引表に使用される：「 C m p d . N o . 」は「化合物番号」を表し、「 E x . 」は「実施例」を表し、化合物が調製される実施例を示す数字に従う。特に指示がない限り、<sup>1</sup> H N

10

20

30

40

50

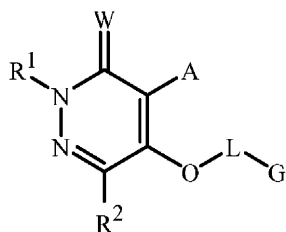
MR 範囲は、DMSO - d<sub>6</sub> 溶液中の、テトラメチルシランから低磁場において、ppm で報告される。「s」は一重項を意味し、「d」は二重線を意味し、「t」は三重項を意味し、「m」は多重項を意味する。

【0286】

索引表 A

【0287】

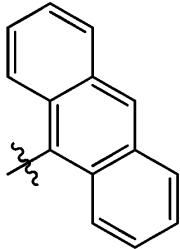
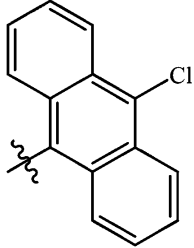
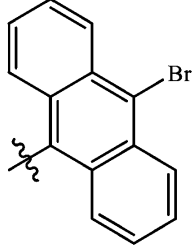
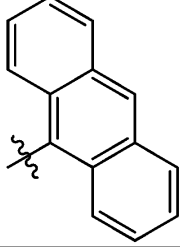
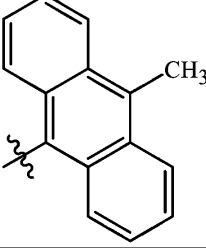
【化38】



WはOである。

【0288】

【表 3 3 - 1】

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	L	G	A	M. P.(°C)
1 (Ex. 1)	Me	Cl	直接結合	H		236~238 *
2 (Ex. 2)	Me	Cl	直接結合	H		*
3	Me	Cl	直接結合	H		*
4	Me	Cl	直接結合	CH <sub>3</sub>		*
5	Me	Cl	直接結合	H		*

10

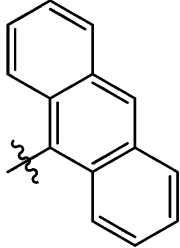
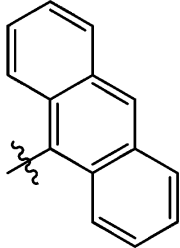
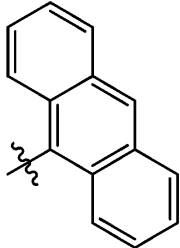
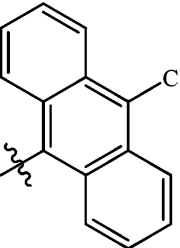
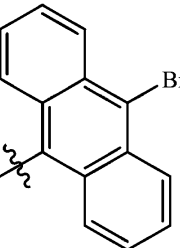
20

30

【 0 2 8 9 】

【表 3 3 - 2】

(上記表の続き)

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	L	G	A	M. P (°C)
6	Me	Cl	直接結合	C(=O)CH <sub>3</sub>		*
7	Me	Cl	直接結合	H (モルホリン塩)		*
8	Me	Me	直接結合	H		*
9	Me	Me	直接結合	H		*
10	Me	Me	直接結合	H		*

\* <sup>1</sup>H NMR 又は M . S . データについては、索引表 B を参照されたい。

【 0 2 9 0 】

## 【表 3 4】

## 索引表 B

化合物番号	<sup>1</sup> H NMRデータ(別段の指示がない限り、DMSO-d <sub>6</sub> 溶液) <sup>a</sup> 及びM. S. データ
1	δ 8. 70(s, 1H), 8. 15(d, 2H), 7. 68(d, 2H), 7. 52(t, 2H), 7. 45(t, 2H), 5. 75(s, 1H), 3. 67(s, 3H)。
2	δ 8. 52(d, 2H), 7. 61(d, 2H), 7. 74(歪んだt, 2H), 7. 56(歪んだt, 2H), 3. 67(s, 3H)。
3	δ 8. 53(d, 2H), 7. 80(d, 2H), 7. 74-7. 71(m, 2H), 7. 56-7. 53(m, 2H), 3. 67(s, 3H)。
4	(CDCl <sub>3</sub> ) δ 8. 57(s, 1H), 8. 08-8. 04(m, 2H), 7. 68-7. 64(m, 2H), 7. 51-7. 46(m, 4H), 3. 82(s, 3H), 3. 05(s, 3H)。
5	δ 11. 05(br s, 1H), 8. 44(d, 2H), 7. 70(d, 2H), 7. 58(t, 2H), 7. 47(t, 2H), 3. 68(s, 3H), 3. 16(s, 3H)。
6	(CDCl <sub>3</sub> ) δ 8. 55(s, 1H), 8. 03(歪んだd, 2H), 7. 60(歪んだd, 2H), 7. 49-7. 42(m, 4H), 3. 91(s, 3H), 1. 68(s, 3H)。
7	335(M-1)。
8	δ 10. 12(s, 1H), 8. 69(s, 1H), 8. 13(d, 2H), 7. 60(d, 2H), 7. 51(t, 2H), 7. 42(t, 2H), 3. 65(s, 3H), 2. 33(s, 3H)。
9	δ 10. 23(s, 1H), 8. 52(d, 2H), 7. 74-7. 70(m, 4H), 7. 57-7. 52(m, 2H), 3. 65(s, 3H), 2. 32(s, 3H)。
10	δ 10. 25(s, 1H), 8. 53(d, 2H), 7. 76-7. 69(m, 4H), 7. 54(dd, 2H), 3. 65(s, 3H), 2. 32(s, 3H)。

10

20

<sup>a</sup> <sup>1</sup>H NMRデータは、テトラメチルシランから低磁場のppmである。カップリングは、(s) - 一重項、(d) - 二重項、(t) - 三重項、(m) - 多重項によって表記される。

## 【0291】

## 本発明の生物学的実施例

## 試験 A

イヌビエ (*Echinochloa crus-galli*)、ホウキギ (*Kochia scoparia*)、ブタクサ (ブタクサ (common ragweed)、(*Ambrosia elatior*))、イタリアンライグラス (ネズミムギ *Lolium multiflorum*)、猫じゃらし (foxtail, green) (エノコログサ、*Setaria viridis*)、及びアオゲイトウ (pigweed) (*Amaranthus retroflexus*) から選択される植物種の種子をローム土壌と砂とのブレンドに植え、界面活性剤を含む非植物毒性溶媒混合物中で配合した試験薬剤を使用して直接土壌噴霧で発芽前処理した。

30

## 【0292】

同時に、これらの雑草種及び更にコムギ (*Triticum aestivum*)、トウモロコシ (*Zea mays*)、ノスズメノテッポウ (*Alopecurus myosuroides*)、及びガリウム (galium) (キャッチウィードベッドストロー (catchweed bedstraw)、*Galium aparine*) から選択される植物をローム土壌と砂との同一のブレンドを含むポットに植え、同様に配合した試験薬剤の発芽後適用で処理した。発芽後処理については、植物は、高さが2~10cmであり、1~2葉期であった。処理した植物及び未処理の対照を温室中におよそ10日間維持し、その後、全ての処理した植物を未処理の対照と比較し、損傷について目視評価した。表Aに要約した植物応答評価は、0~100スケールに基づいており、0は効果なしであり、100は完全な防除である。ダッシュ(-) 応答は、試験結果が得られなかったことを意味する。

40

## 【0293】

【表 3 5】

表A	化合物						
125g ai/ha	1	2	3	5	6	7	8
発芽後							
イヌビエ	20	20	60	30	10	0	50
ノズメノテッポウ	10	60	70	0	0	10	30
トウモロコシ	0	0	10	20	0	10	10
アキノエノコログサ	—	—	—	—	20	10	60
猫じゃらし	50	60	90	30	—	—	—
ガリウム	90	100	90	70	100	100	90
ホウキギ	20	70	50	0	20	10	10
アオゲイトウ	100	100	100	90	100	100	100
ブタクサ	90	90	90	20	90	100	90
イタリアンライグラス	40	80	50	50	70	60	100
コムギ	10	30	60	0	10	0	0
表A	化合物						
31g ai/ha	1	2	3	5	6	7	8
発芽後							
イヌビエ	0	0	20	0	0	0	10
ノズメノテッポウ	0	0	10	0	0	0	0
トウモロコシ	0	0	0	10	0	10	10
アキノエノコログサ	—	—	—	—	0	0	10
猫じゃらし	10	10	40	0	—	—	—
ガリウム	70	20	90	20	80	70	80
ホウキギ	10	10	10	0	0	0	0
アオゲイトウ	90	100	100	50	100	100	90
ブタクサ	80	90	80	10	90	90	90
イタリアンライグラス	20	50	40	0	20	10	90
コムギ	0	0	20	0	10	0	0
表A	化合物						
125g ai/ha	1	2	3	5	6	7	8
発芽前							
イヌビエ	0	0	50	0	0	0	10
アキノエノコログサ	—	—	—	—	10	0	10
猫じゃらし	0	90	80	0	—	—	—
ホウキギ	20	10	50	0	0	0	0
アオゲイトウ	100	100	100	60	100	100	100
ブタクサ	100	100	100	0	100	40	90
イタリアンライグラス	30	70	80	0	30	0	50
表A	化合物						
31g ai/ha	1	2	3	5	6	7	8
発芽前							
イヌビエ	0	0	0	0	0	0	0
アキノエノコログサ	—	—	—	—	0	0	0
猫じゃらし	0	0	10	0	—	—	—
ホウキギ	0	0	0	0	0	0	0
アオゲイトウ	100	100	100	0	80	60	100
ブタクサ	70	80	20	0	40	0	40
イタリアンライグラス	20	20	20	0	30	0	10

【 0 2 9 4】

## 試験 B

イネ (*Oryza sativa*)、カヤツリグサ (タマガヤツリ (*small-flower umbrella sedge*))、*Cyperus difformis*)、アメリカコナギ (*ducksalad*) (*Heteranthera limosa*) 及びイヌビエ (*Echinochlo*

10

20

30

40

50



a c r u s - g a l l i ) から選択される、冠水させた水田試験 (flooded paddy test) における植物種を試験のために 2 葉期まで成長させた。処理時に、試験ポットを土壌表面から 3 c m 上まで冠水させ、試験化合物を田面水 (paddy water) に直接適用することにより処理し、その後は、試験期間中その水深で維持した。処理した植物及び対照を温室中で 1 3 ~ 1 5 日間維持し、その後に、全ての種を対照と比較して目視評価した。表 B に要約した植物の応答評価は、0 ~ 1 0 0 のスケールに基づいており、0 は効果なしであり、1 0 0 は完全な防除である。ダッシュ ( - ) 応答は、試験結果が得られなかったことを意味する。

【 0 2 9 5 】

【表 3 6 】

表B	化合物					
250g ai/ha	1	2	5	6	7	8
冠水						
イヌビエ	20	0	0	0	0	15
アメリカコナギ	85	80	90	85	100	90
イネ	0	0	0	0	0	15
カヤツリグサ	90	75	95	95	100	90

---

フロントページの続き

審査官 高橋 直子

- (56)参考文献 国際公開第2017/074992(WO,A1)  
国際公開第2015/168010(WO,A1)  
国際公開第2009/035150(WO,A2)  
英国特許出願公開第2519092(GB,A)

(58)調査した分野(Int.Cl.,DB名)

C07D 237/16

A01N 43/58

A01P 13/00

C A p l u s / R E G I S T R Y ( S T N )