

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2005-516973

(P2005-516973A)

(43) 公表日 平成17年6月9日(2005.6.9)

(51) Int.Cl.⁷

C07D 498/04

A01N 25/02

A01N 25/04

A01N 25/12

A01N 25/14

F I

C07D 498/04

116

C07D 498/04

CSP

A01N 25/02

A01N 25/04

101

A01N 25/04

102

テーマコード (参考)

4C072

4H011

審査請求 有 予備審査請求 有 (全 88 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2003-562121 (P2003-562121)

(86) (22) 出願日 平成15年1月21日 (2003.1.21)

(85) 翻訳文提出日 平成16年7月22日 (2004.7.22)

(86) 国際出願番号 PCT/EP2003/000555

(87) 国際公開番号 W02003/062244

(87) 国際公開日 平成15年7月31日 (2003.7.31)

(31) 優先権主張番号 2002 0119/02

(32) 優先日 平成14年1月22日 (2002.1.22)

(33) 優先権主張国 スイス (CH)

(71) 出願人 500584309

シンジェンタ パーティシペーションズ

アクチエンゲゼルシャフト

スイス国, ツューハー 4058 バーゼル,

シュバルツバルトアレー 215

(74) 代理人 100099759

弁理士 青木 篤

(74) 代理人 100077517

弁理士 石田 敬

(74) 代理人 100087413

弁理士 古賀 哲次

(74) 代理人 100129517

弁理士 栗田 博道

(74) 代理人 100082898

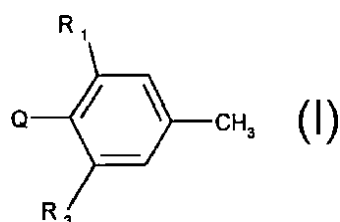
弁理士 西山 雅也

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 除草剤として有用なフェニル置換ヘテロ環化合物

(57) 【要約】

式 I [式中、置換基は請求項 1 で定義される通りである] の化合物、ならびに該化合物の栽培学的に許容される塩、異性体およびエナンチオマーは、除草剤としての使用に適している。

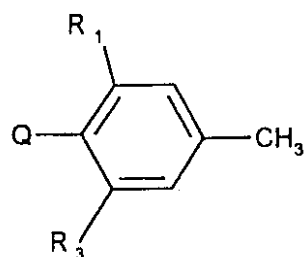


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式 I :

【化 1】



(I),

10

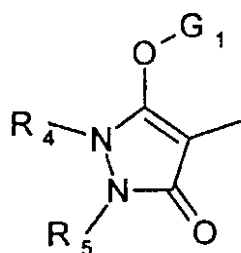
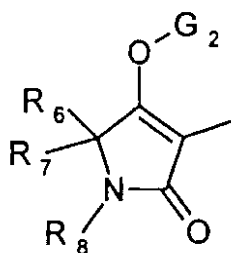
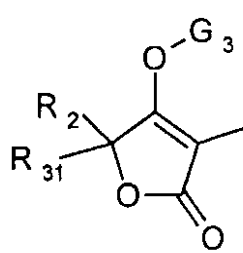
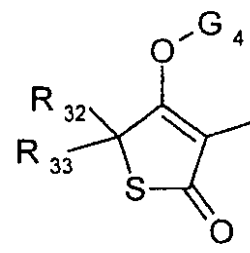
[式中

R_1 および R_3 は各々他とは独立して、エチル、ハロエチル、エチニル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ、 $C_1 - C_2$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_2$ アルキルカルボニル、 $C_1 - C_2$ ヒドロキシアルキルまたは $C_1 - C_2$ アルコキシカルボニルであり；

20

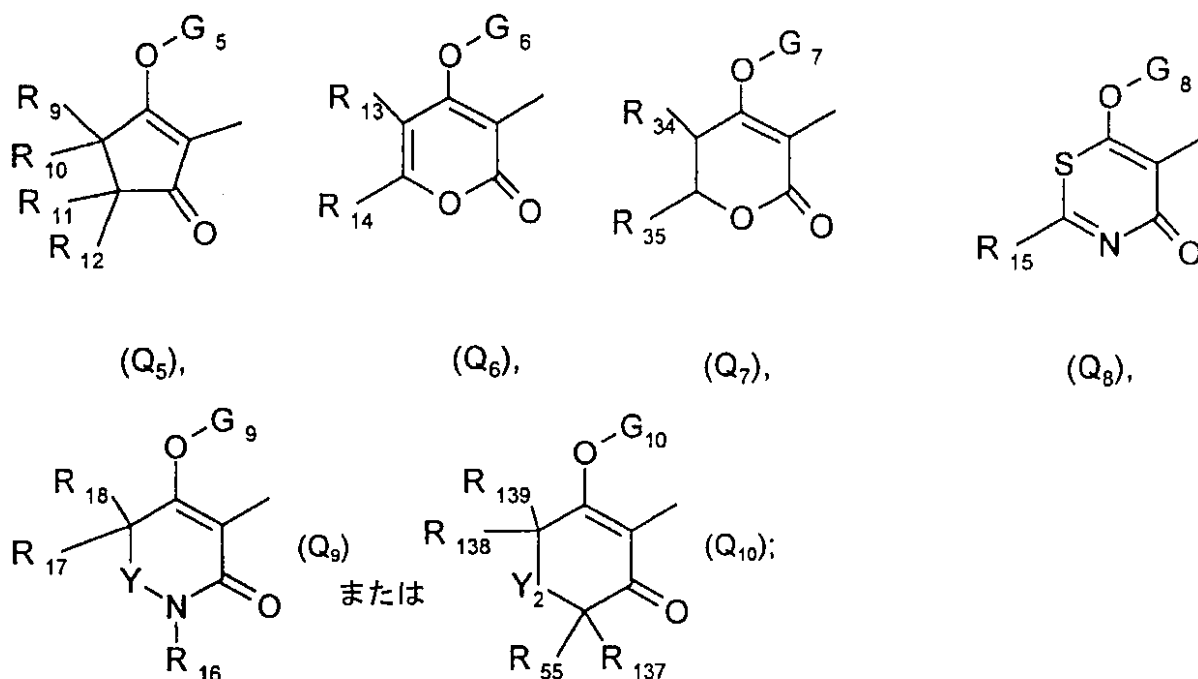
Q は下記：

【化 2】

(Q₁),(Q₂),(Q₃),(Q₄),

30

【化 3】



10

20

の基であり；

R₄ および R₅ は各々他とは独立して、C₁ - C₁₀ アルキル、C₂ - C₁₀ アルケニル、C₂ - C₁₀ アルキニル、C₁ - C₁₀ ハロアルキル、C₂ - C₁₀ アルコキシアリル、C₃ - C₁₀ アルケニルオキシアリル、C₃ - C₁₀ アルキニルオキシアリル、C₂ - C₁₀ アルキルチオアルキル、C₂ - C₁₀ アルキルスルフィニルアルキル、C₂ - C₁₀ アルキルスルホニルアルキル、C₂ - C₁₀ アルキルカルボニルアルキル、C₂ - C₁₀ - N - アルコキシ - イミノアルキル、C₂ - C₁₀ アルコキシカルボニルアルキル、C₁ - C₁₀ アミノアルキル、C₃ - C₁₀ ジアルキルアミノアルキル、C₂ - C₁₀ アルキルアミノアルキル、C₁ - C₁₀ シアノアルキル、C₄ - C₁₀ シクロアルキルアルキル、C₁ - C₁₀ フェニルアルキル、C₁ - C₁₀ ヘテロアリールアルキル、C₁ - C₁₀ フェノキシアリル、C₁ - C₁₀ ヘテロアリールオキシアリル、C₁ - C₁₀ アルキリデンアミノオキシアリル、C₁ - C₁₀ ニトロアルキル、C₁ - C₁₀ トリアルキルシリルアルキル、C₂ - C₁₀ アルキルアミノカルボニルアルキル、C₂ - C₁₀ ジアルキルアミノカルボニルアルキル、C₂ - C₁₀ アルキルアミノカルボニルオキシアリル、C₃ - C₁₀ ジアルキルアミノカルボニルオキシアリル、C₂ - C₁₀ アルコキシカルボニルアミノアルキル、C₁ - C₁₀ - N - アルコキシカルボニル - N - アルキルアミノ - アルキル、C₁ - C₁₀ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；あるいは、

30

40

R₄ および R₅ はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよく、そして酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい 2 ~ 6 炭素原子からなる縮合した又はスピロ結合したアルキレンまたはアルケニレン鎖を追加的に含んでもよい 5 ~ 7 員環を形成し、当該環はフェニルにより又はベンジルにより置換されてよく、該フェニルおよびベンジルの各々もまたハロゲン、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ ハロアルキル、C₃ - C₆ シクロアルキル、ヒドロキシ、C₁ - C₆ アルコキシ、C₁ - C₆ アルコキシ - C₁ - C₆ アルコキシ、C₁ - C₆ ハロアルコキシにより又はニトロにより置換されてよく、

R₂、R₆ および R₃₂ は各々他とは独立して、C₁ - C₁₀ アルキル、C₂ - C₁₀ アルケニル、C₂ - C₁₀ アルキニル、C₁ - C₁₀ ハロアルキル、C₂ - C₁₀ アルコキシアリル

50

ル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリーールまたはヘテロアリーールであり；

R_7 、 R_{31} および R_{33} は各々他とは独立して、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニルまたは $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキルであり、

R_8 は、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリーールまたはヘテロアリーールであり；あるいは、

R_6 および R_7 、または R_2 および R_{31} 、または R_{32} および R_{33} はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい飽和 3 ~ 7 員環を形成し；あるいは、 R_6 および R_8 はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい 5 ~ 7 員環を形成し；

R_9 、 R_{10} 、 R_{11} および R_{12} は各々他とは独立して、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリーールまたはヘテロアリーールであり；あるいは、

R_9 および R_{11} 、または R_9 および R_{10} はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい 5 ~ 7 員環を形成し；

R_{13} 、 R_{14} 、 R_{34} および R_{35} は各々他とは独立して、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリーールまたはヘテロアリーールであり；あるいは、

R_{13} および R_{14} 、または R_{34} および R_{35} はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい 5 ~ 7 員環を形成し；

R_{15} は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_1 - C_{10}$ アミノアルキル、 $C_3 - C_{10}$ ジアルキルアミノアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルアミノアルキル、 $C_1 - C_{10}$ シアノアルキル、 $C_4 - C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 - C_{10}$ フェニルアルキル、 $C_1 - C_{10}$ ヘテロアリーールアルキル、 $C_1 - C_{10}$ フェノキシアルキル、 $C_1 - C_{10}$ ヘテロアリーールオキシアルキル、 $C_1 - C_{10}$ ニトロアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリーールまたはヘテロアリーールであり；

R_{16} は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリーールまたはヘテロアリーールであり；

R_{17} は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 -$

10

20

30

40

50

C_{10} ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；

R_{18} は、水素、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ アルキルまたは $C_1 - C_{10}$ アルコキシアルキルであり；あるいは、

R_{17} および R_{18} はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい 3 ~ 7 員環を形成し；

Y は酸素、硫黄、 $C - R_{19}$ または $N - R_{36}$ であり；

R_{19} および R_{36} は各々他とは独立して、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、フェニルまたはヘテロアリールであり；あるいは、

R_{18} および R_{19} 、または R_{18} および R_{36} はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい飽和 5 ~ 7 員環を形成し；

G_1 、 G_2 、 G_3 、 G_4 、 G_5 、 G_6 、 G_7 、 G_8 、 G_9 および G_{10} は各々他とは独立して、 $-C(X_1) - R_{20}$ 、 $-C(X_2) - X_3 - R_{21}$ 、 $-C(X_4) - N(R_{22}) - R_{23}$ 、 $-SO_2 - R_{24}$ 、 $-S(R_{200})_3$ 、 $-N(R_{300})_4$ 、 $-P(R_{400})_4$ 、 $-P(X_5)(R_{25}) - R_{26}$ または $-CH_2 - X_6 - R_{27}$ であり；

X_1 、 X_2 、 X_3 、 X_4 、 X_5 および X_6 は各々他とは独立して、酸素または硫黄であり；

R_{20} 、 R_{21} 、 R_{24} 、 R_{27} ならびに置換基 R_{200} の少なくとも 1 つ、置換基 R_{300} の少なくとも 1 つ、置換基 R_{400} の少なくとも 1 つ、置換基 R_{22} および R_{23} の少なくとも 1 つ、および置換基 R_{25} および R_{26} の少なくとも 1 つは各々、 $C_9 - C_{32}$ アルキル、1 個以上の $C_1 - C_8$ アルキル基により置換された $C_9 - C_{32}$ アルキル、 $C_9 - C_{32}$ アルケニル、または 1 個以上の $C_1 - C_8$ アルキル基により置換された $C_9 - C_{32}$ アルケニルであり、

残りの置換基 R_{200} は追加的に、 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、フェニルであるか、またはアルキル、ハロゲン、アルコキシ、チオアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、シアノにより又はニトロにより置換されたフェニルであり、あるいは 2 つの置換基 R_{200} がそれらの結合する硫黄原子と一緒にあって、酸素、窒素または硫黄原子により分断されてよい 5 ~ 8 員環を形成し、

残りの置換基 R_{300} は R_{200} について定義された通りであるが、追加的に水素の意味であってよく、

残りの置換基 R_{400} は追加的に、 $C_1 - C_8$ アルキル、フェニルであるか、またはアルキル、ハロゲン、アルコキシ、チオアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、シアノにより又はニトロにより置換されたフェニルであり、あるいは 2 つの置換基 R_{400} がそれらの結合するリン原子と一緒にあって、酸素、窒素または硫黄原子により分断されてよい 5 ~ 8 員環を形成し、

R_{22} および R_{23} は追加的に、各々他とは独立して、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1 - C_{10}$ シアノアルキル、 $C_1 - C_{10}$ ニトロアルキル、 $C_1 - C_{10}$ アミノアルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_4 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_4 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルスルホキシル、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルキリデンアミノ、オキシ、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルカルボニル、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アミノカルボニル、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 -$

10

20

30

40

50

C_8 ジアルキルアミノカルボニル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルカルボニルア
 ミノ - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルカルボニル - ($C_2 - C_5$ アルキル) - ア
 ミノアルキル、 $C_3 - C_6$ トリアルキルシリル - $C_1 - C_5$ アルキル、フェニル - $C_1 - C_5$
 アルキル、ヘテロアリール - $C_1 - C_5$ アルキル、フェノキシ - $C_1 - C_5$ アルキル、ヘ
 テロアリールオキシ - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_5$ アルケニル、 $C_2 - C_5$ ハロアルケ
 ニル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、あるいはフェニル、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 -$
 C_3 ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノ
 により又はニトロにより置換されたフェニル、あるいはヘテロアリールまたはヘテロアリ
 ールアミノ、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ
 、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたヘテ
 ロアリールまたはヘテロアリールアミノ、あるいはジヘテロアリールアミノ、または C_1
 - C_3 アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコ
 キシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたジヘテロアリールアミノ、あ
 るいはフェニルアミノ、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$
 アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換
 されたフェニルアミノ、あるいはジフェニルアミノ、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C$
 3 ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノに
 より又はニトロにより置換されたジフェニルアミノ、あるいは $C_3 - C_7$ シクロアルキル
 アミノ、ジ - $C_3 - C_7$ シクロアルキルアミノまたは $C_3 - C_7$ シクロアルコキシであり；
 R_{25} および R_{26} は追加的に、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 C
 $2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1 - C_{10}$ シアノアルキル、 $C_1 - C_{10}$
 ニトロアルキル、 $C_1 - C_{10}$ アミノアルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルアミノ - $C_1 - C_5$ アル
 キル、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノ - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル - C_1
 - C_5 アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_4 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル
 、 $C_4 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_1 - C_5$
 アルキルスルホキシル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルスルホニル - $C_1 - C_5$
 アルキル、 $C_2 - C_8$ アルキリデンアミノ - オキシ - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アル
 キルカルボニル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルコキシカルボニル - $C_1 - C_5$ アル
 キル、 $C_1 - C_5$ アミノ - カルボニル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノ
 カルボニル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルカルボニルアミノ - $C_1 - C_5$ アル
 キル、 $C_1 - C_5$ アルキルカルボニル - ($C_2 - C_5$ アルキル) - アミノアルキル、 $C_3 -$
 C_6 トリアルキルシリル - $C_1 - C_5$ アルキル、フェニル - $C_1 - C_5$ アルキル、ヘテロア
 リール - $C_1 - C_5$ アルキル、フェノキシ - $C_1 - C_5$ アルキル、ヘテロアリールオキシ -
 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_5$ アルケニル、 $C_2 - C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 - C_8$ シクロ
 アルキル、あるいはフェニル、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 C_1
 - C_3 アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロによ
 り置換されたフェニル、あるいはヘテロアリールまたはヘテロアリールアミノ、または C
 $1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコ
 キシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたヘテロアリールまたはヘテロ
 アリールアミノ、あるいはジヘテロアリールアミノ、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C$
 3 ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノに
 より又はニトロにより置換されたジヘテロアリールアミノ、あるいはフェニルアミノ、ま
 たは $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロ
 アルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたフェニルアミノ、あ
 るいはジフェニルアミノ、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$
 アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換
 されたジフェニルアミノ、あるいは $C_3 - C_7$ シクロアルキルアミノ、ジ - $C_3 - C_7$ シク
 ロアルキルアミノ、 $C_3 - C_7$ シクロアルコキシ、 $C_1 - C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 - C_{10}$ ハ
 ロアルコキシ、 $C_1 - C_5$ アルキルアミノ、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノ、ベンジルオキシ
 またはフェノキシであり、前記ベンジルおよびフェニル基もまた $C_1 - C_3$ アルキル、 C_1

10

20

30

40

50

- C_3 ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されてよく；

Y_2 は酸素、硫黄、 $C - R_{140} - R_{141}$ または $N - R_{142}$ であり；

R_{55} は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；

R_{137} は、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニルまたは $C_1 - C_{10}$ アルコキシアルキルであり；あるいは、

R_{55} および R_{137} はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい 3 ~ 7 員環を形成し；

R_{138} および R_{139} は各々他とは独立して、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニルまたは $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキルであり；そして、

R_{140} および R_{141} は各々他とは独立して、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニルまたは $C_1 - C_{10}$ アルコキシアルキルであり；あるいは

R_{55} および $C - R_{140}$ はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい飽和または不飽和 3 ~ 7 員環を形成し；

R_{142} は、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；あるいは、

R_{55} および $N - R_{142}$ はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい飽和または不飽和 3 ~ 7 員環を形成する]

の化合物、あるいは該化合物の栽培学的に許容される塩、異性体またはエナンチオマー。

【請求項 2】

Q が Q_1 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R_{20} 、 R_{21} 、 R_{24} 、 R_{27} ならびに置換基 R_{200} の少なくとも 1 つ、置換基 R_{300} の少なくとも 1 つ、置換基 R_{400} の少なくとも 1 つ、置換基 R_{22} および R_{23} の少なくとも 1 つ、および置換基 R_{25} および R_{26} の少なくとも 1 つが各々、分岐していない $C_9 - C_{25}$ アルキル、カルボニル基に対して 位で 1 個以上の $C_1 - C_4$ アルキル基により置換された分岐していない $C_9 - C_{25}$ アルキル、分岐していない $C_9 - C_{25}$ アルケニル、またはカルボニル基に対して 位で 1 個以上の $C_1 - C_4$ アルキル基により置換された分岐していない $C_9 - C_{25}$ アルケニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

前記アルケニル基および $C_1 - C_4$ アルキル置換アルケニル基がシス配置の単一の二重結合を有する、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

下記式 I I：

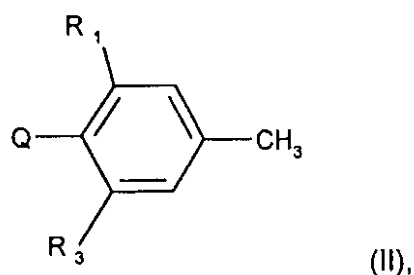
10

20

30

40

【化 4】



10

[式中、 R_1 および R_3 は式 I について定義された通りであり、 Q は Q_1 、 Q_2 、 Q_3 、 Q_4 、 Q_5 、 Q_6 、 Q_7 、 Q_8 、 Q_9 または Q_{10} であり、式中、置換基 G_1 、 G_2 、 G_3 、 G_4 、 G_5 、 G_6 、 G_7 、 G_8 、 G_9 および G_{10} は水素である]

の化合物を、不活性溶媒および塩基の存在下で、下記式 III :



[式中、Hal は塩素、臭素またはヨウ素であり、 G は $-\text{C}(\text{X}_1) - \text{R}_{20}$ 、 $-\text{C}(\text{X}_2) - \text{X}_3 - \text{R}_{21}$ 、 $-\text{C}(\text{X}_4) - \text{N}(\text{R}_{22}) - \text{R}_{23}$ 、 $-\text{SO}_2 - \text{R}_{24}$ 、 $-\text{S}(\text{R}_{200})_3$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{300})_4$ 、 $-\text{P}(\text{R}_{400})_4$ 、 $-\text{P}(\text{X}_5)(\text{R}_{25}) - \text{R}_{26}$ または $-\text{CH}_2 - \text{X}_6 - \text{R}_{27}$ であり、式中、 X_1 、 X_2 、 X_3 、 X_4 、 X_5 および X_6 ならびに R_{20} 、 R_{21} 、 R_{22} 、 R_{23} 、 R_{24} 、 R_{200} 、 R_{300} 、 R_{400} 、 R_{25} 、 R_{26} および R_{27} は定義された通りである]

の化合物と反応させることを含んでなる、請求項 1 に記載の式 I の化合物の調製方法。

【請求項 6】

不活性担体上に、除草剤として有効な量の式 I の化合物を含んでなる、除草および植物生長阻害組成物。

【請求項 7】

不活性担体上に、除草剤として有効な量の式 I の化合物、および除草剤拮抗作用のために有効な量の毒性緩和剤を含んでなる、除草および植物生長阻害組成物。

30

【請求項 8】

不活性担体上に、除草剤として有効な量の式 I の化合物、および相乗作用のために有効な量の共除草剤 (co-herbicide) を含んでなる、除草および植物生長阻害組成物。

【請求項 9】

望ましくない植物またはその位置に対し、除草剤として有効な量の式 I の化合物または該化合物を含む組成物を適用することを含んでなる、望ましくない植物の生長抑制方法。

【請求項 10】

植物またはその位置に対し、除草剤として有効な量の式 I の化合物または該化合物を含む組成物を適用することを含んでなる、植物の生長阻害方法。

【発明の詳細な説明】

40

【技術分野】

【0001】

本発明は新規な、除草活性のある、フェニル基により置換されたヘテロ環化合物、それらの調製方法、それらの化合物を含んでなる組成物、そして雑草の抑制、特に有用植物の栽培または植物生長阻害におけるそれらの使用に関する。

【背景技術】

【0002】

除草作用を有する 3 - ヒドロキシ - 4 - アリール - 5 - オキソ - ピラゾリン誘導体が、例えば、国際公開公報 WO 01 / 17972 号に記載されている。

【発明の開示】

50

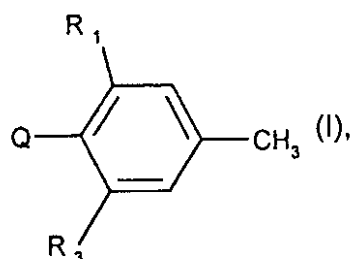
【 0 0 0 3 】

除草および生長阻害活性を有する、新規なフェニル基により置換されたヘテロ環化合物が今般見いだされた。

【 0 0 0 4 】

従って、本発明は下記式 I :

【 化 1 】



10

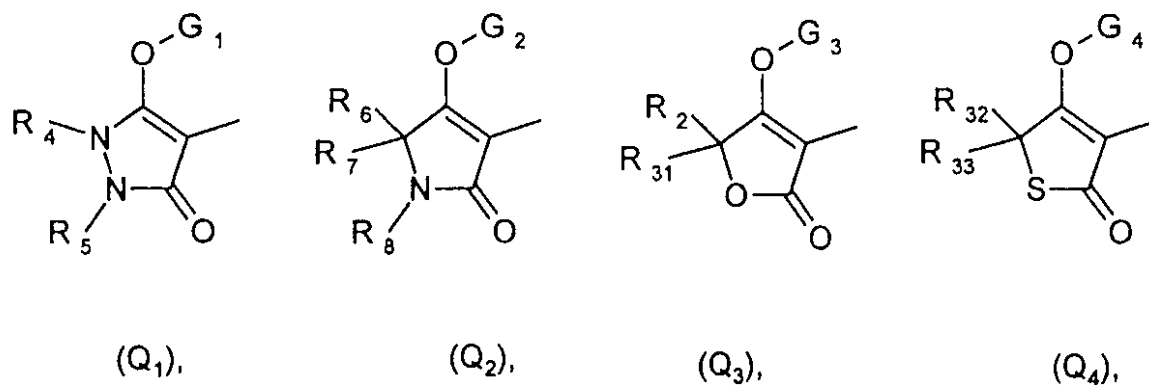
[式中

R_1 および R_3 は各々他とは独立して、エチル、ハロエチル、エチニル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ、 $C_1 - C_2$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_2$ アルキルカルボニル、 $C_1 - C_2$ ヒドロキシアルキルまたは $C_1 - C_2$ アルコキシカルボニルであり；

20

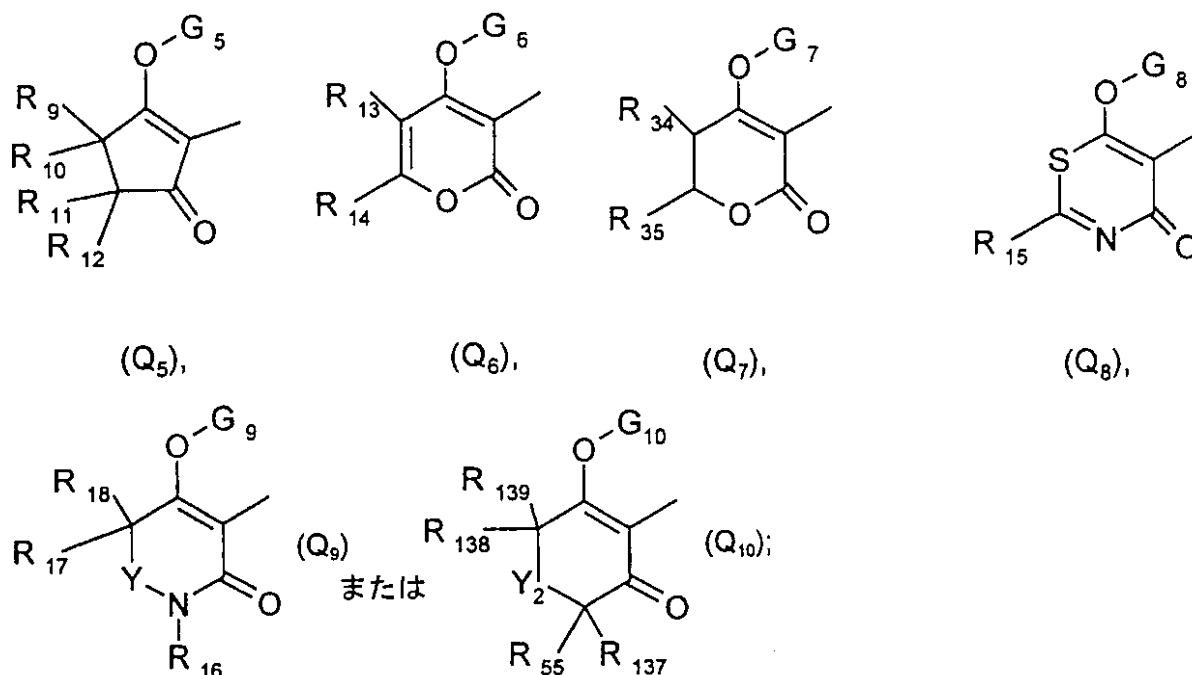
Q は下記：

【 化 2 】



30

【化 3】



10

20

の基であり；

R₄ および R₅ は各々他とは独立して、C₁ - C₁₀ アルキル、C₂ - C₁₀ アルケニル、C₂ - C₁₀ アルキニル、C₁ - C₁₀ ハロアルキル、C₂ - C₁₀ アルコキシアリル、C₃ - C₁₀ アルケニルオキシアリル、C₃ - C₁₀ アルキニルオキシアリル、C₂ - C₁₀ アルキルチオアルキル、C₂ - C₁₀ アルキルスルフィニルアルキル、C₂ - C₁₀ アルキルスルホニルアルキル、C₂ - C₁₀ アルキルカルボニルアルキル、C₂ - C₁₀ - N - アルコキシ - イミノアルキル、C₂ - C₁₀ アルコキシカルボニルアルキル、C₁ - C₁₀ アミノアルキル、C₃ - C₁₀ ジアルキルアミノアルキル、C₂ - C₁₀ アルキルアミノアルキル、C₁ - C₁₀ シアノアルキル、C₄ - C₁₀ シクロアルキルアルキル、C₁ - C₁₀ フェニルアルキル、C₁ - C₁₀ ヘテロアリールアルキル、C₁ - C₁₀ フェノキシアリル、C₁ - C₁₀ ヘテロアリールオキシアリル、C₁ - C₁₀ アルキリデンアミノオキシアリル、C₁ - C₁₀ ニトロアルキル、C₁ - C₁₀ トリアルキルシリルアルキル、C₂ - C₁₀ アルキルアミノカルボニルアルキル、C₂ - C₁₀ ジアルキルアミノカルボニルアルキル、C₂ - C₁₀ アルキルアミノカルボニルオキシアリル、C₃ - C₁₀ ジアルキルアミノカルボニルオキシアリル、C₂ - C₁₀ アルコキシカルボニルアミノアルキル、C₁ - C₁₀ - N - アルコキシカルボニル - N - アルキルアミノ - アルキル、C₁ - C₁₀ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；あるいは、

30

R₄ および R₅ はそれらが結合する原子と一緒に、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよく、そして 2 ~ 6 炭素原子（これらも酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい）からなる縮合した又はスピロ結合したアルキレンまたはアルケニレン鎖を追加的に含んでもよい 5 ~ 7 員環を形成し、当該環はフェニルにより又はベンジルにより置換されてよく、該フェニルおよびベンジルの各々もまたハロゲン、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ ハロアルキル、C₃ - C₆ シクロアルキル、ヒドロキシ、C₁ - C₆ アルコキシ、C₁ - C₆ アルコキシ - C₁ - C₆ アルコキシ、C₁ - C₆ ハロアルコキシにより又はニトロにより置換されてよく、

40

R₂、R₆ および R₃₂ は各々他とは独立して、C₁ - C₁₀ アルキル、C₂ - C₁₀ アルケニル、C₂ - C₁₀ アルキニル、C₁ - C₁₀ ハロアルキル、C₂ - C₁₀ アルコキシアリル、C₃ - C₁₀ アルケニルオキシアリル、C₃ - C₁₀ アルキニルオキシアリル、C₂

50

- C_{10} アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；

R_7 、 R_{31} および R_{33} は各々他とは独立して、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニルまたは $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキルであり、

R_8 は、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；あるいは、

R_6 および R_7 、または R_2 および R_{31} 、または R_{32} および R_{33} はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい飽和 3 ~ 7 員環を形成し；あるいは、 R_6 および R_8 はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい 5 ~ 7 員環を形成し；

R_9 、 R_{10} 、 R_{11} および R_{12} は各々他とは独立して、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；あるいは、

R_9 および R_{11} 、または R_9 および R_{10} はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい 5 ~ 7 員環を形成し；

R_{13} 、 R_{14} 、 R_{34} および R_{35} は各々他とは独立して、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；あるいは、

R_{13} および R_{14} 、または R_{34} および R_{35} はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい 5 ~ 7 員環を形成し；

R_{15} は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_1 - C_{10}$ アミノアルキル、 $C_3 - C_{10}$ ジアルキルアミノアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルアミノアルキル、 $C_1 - C_{10}$ シアノアルキル、 $C_4 - C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 - C_{10}$ フェニルアルキル、 $C_1 - C_{10}$ ヘテロアリールアルキル、 $C_1 - C_{10}$ フェノキシアルキル、 $C_1 - C_{10}$ ヘテロアリールオキシアルキル、 $C_1 - C_{10}$ ニトロアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；

R_{16} は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；

R_{17} は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアル

10

20

30

40

50

キル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；

R_{18} は、水素、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ アルキルまたは $C_1 - C_{10}$ アルコキシアルキルであり；あるいは、

R_{17} および R_{18} はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい 3 ~ 7 員環を形成し；

Y は酸素、硫黄、 $C - R_{19}$ または $N - R_{36}$ であり；

R_{19} および R_{36} は各々他とは独立して、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、フェニルまたはヘテロアリールであり；あるいは、

R_{18} および R_{19} 、または R_{18} および R_{36} はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい飽和 5 ~ 7 員環を形成し；

G_1 、 G_2 、 G_3 、 G_4 、 G_5 、 G_6 、 G_7 、 G_8 、 G_9 および G_{10} は各々他とは独立して、 $-C(X_1)-R_{20}$ 、 $-C(X_2)-X_3-R_{21}$ 、 $-C(X_4)-N(R_{22})-R_{23}$ 、 $-SO_2-R_{24}$ 、 $-S(R_{200})_3$ 、 $-N(R_{300})_4$ 、 $-P(R_{400})_4$ 、 $-P(X_5)(R_{25})-R_{26}$ または $-CH_2-X_6-R_{27}$ であり；

X_1 、 X_2 、 X_3 、 X_4 、 X_5 および X_6 は各々他とは独立して、酸素または硫黄であり；

R_{20} 、 R_{21} 、 R_{24} 、 R_{27} ならびに置換基 R_{200} の少なくとも 1 つ、置換基 R_{300} の少なくとも 1 つ、置換基 R_{400} の少なくとも 1 つ、置換基 R_{22} および R_{23} の少なくとも 1 つ、および置換基 R_{25} および R_{26} の少なくとも 1 つは各々、 $C_9 - C_{32}$ アルキル、1 個以上の $C_1 - C_8$ アルキル基により置換された $C_9 - C_{32}$ アルキル、 $C_9 - C_{32}$ アルケニル、または 1 個以上の $C_1 - C_8$ アルキル基により置換された $C_9 - C_{32}$ アルケニルであり、

残りの置換基 R_{200} は追加的に、 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、フェニルであるか、またはアルキル、ハロゲン、アルコキシ、チオアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、シアノにより又はニトロにより置換されたフェニルであり、あるいは 2 つの置換基 R_{200} がそれらの結合する硫黄原子と一緒にあって、酸素、窒素または硫黄原子により分断されてよい 5 ~ 8 員環を形成し、

残りの置換基 R_{300} は追加的に、水素、 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、フェニルであるか、またはアルキル、ハロゲン、アルコキシ、チオアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、シアノ又はニトロにより置換されたフェニルであり、あるいは 2 つの置換基 R_{300} がそれらの結合する窒素原子と一緒にあって、酸素、窒素または硫黄原子により分断されてよい 5 ~ 8 員環を形成し、

残りの置換基 R_{400} は追加的に、 $C_1 - C_8$ アルキル、フェニルであるか、またはアルキル、ハロゲン、アルコキシ、チオアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、シアノにより又はニトロにより置換されたフェニルであり、あるいは 2 つの置換基 R_{400} がそれらの結合するリン原子と一緒にあって、酸素、窒素または硫黄原子により分断されてよい 5 ~ 8 員環を形成し、

R_{22} および R_{23} は追加的に、各々他とは独立して、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1 - C_{10}$ シアノアルキル、 $C_1 - C_{10}$ ニトロアルキル、 $C_1 - C_{10}$ アミノアルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_4 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_4 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルスルホキシル、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルキリデンアミノ、オキシ、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルカルボニル、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルコキシカ

10

20

30

40

50

ルボニル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アミノカルボニル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノカルボニル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルカルボニルアミノ - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルカルボニル - ($C_2 - C_5$ アルキル) - アミノアルキル、 $C_3 - C_6$ トリアルキルシリル - $C_1 - C_5$ アルキル、フェニル - $C_1 - C_5$ アルキル、ヘテロアリール - $C_1 - C_5$ アルキル、フェノキシ - $C_1 - C_5$ アルキル、ヘテロアリールオキシ - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_5$ アルケニル、 $C_2 - C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、あるいはフェニル、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたフェニル、あるいはヘテロアリールまたはヘテロアリールアミノ、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたヘテロアリールまたはヘテロアリールアミノ、あるいはジヘテロアリールアミノ、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたジヘテロアリールアミノ、あるいはフェニルアミノ、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたフェニルアミノ、あるいはジフェニルアミノ、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたジフェニルアミノ、あるいは $C_3 - C_7$ シクロアルキルアミノ、ジ - $C_3 - C_7$ シクロアルキルアミノまたは $C_3 - C_7$ シクロアルコキシであり；

R_{25} および R_{26} は追加的に、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1 - C_{10}$ シアノアルキル、 $C_1 - C_{10}$ ニトロアルキル、 $C_1 - C_{10}$ アミノアルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルアミノ - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノ - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_4 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_4 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルスルホキシル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルスルホニル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルキリデンアミノ - オキシ - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルカルボニル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルコキシカルボニル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アミノ - カルボニル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノカルボニル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルカルボニルアミノ - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルカルボニル - ($C_2 - C_5$ アルキル) - アミノアルキル、 $C_3 - C_6$ トリアルキルシリル - $C_1 - C_5$ アルキル、フェニル - $C_1 - C_5$ アルキル、ヘテロアリール - $C_1 - C_5$ アルキル、フェノキシ - $C_1 - C_5$ アルキル、ヘテロアリールオキシ - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_5$ アルケニル、 $C_2 - C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、あるいはフェニル、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたフェニル、あるいはヘテロアリールまたはヘテロアリールアミノ、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたヘテロアリールまたはヘテロアリールアミノ、あるいはジヘテロアリールアミノ、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたジヘテロアリールアミノ、あるいはフェニルアミノ、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたフェニルアミノ、あるいはジフェニルアミノ、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたジフェニルアミノ、あるいは $C_3 - C_7$ シクロアルキルアミノ、ジ - $C_3 - C_7$ シクロアルキルアミノ、または $C_3 - C_7$ シクロアルコキシ、 $C_1 - C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_5$ アルキルアミノ、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノ、ベンジル

オキシまたはフェノキシであり、前記ベンジルおよびフェニル基もまた $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されてよく；

Y_2 は酸素、硫黄、 $C - R_{140} - R_{141}$ または $N - R_{142}$ であり；

R_{55} は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；

10

R_{137} は、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニルまたは $C_1 - C_{10}$ アルコキシアルキルであり；あるいは、

R_{55} および R_{137} はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい 3 ~ 7 員環を形成し；

R_{138} および R_{139} は各々他とは独立して、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニルまたは $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキルであり；そして、

R_{140} および R_{141} は各々他とは独立して、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニルまたは $C_1 - C_{10}$ アルコキシアルキルであり；あるいは

R_{55} および $C - R_{140}$ はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい飽和または不飽和 3 ~ 7 員環を形成し；

20

R_{142} は、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；あるいは、

R_{55} および $N - R_{142}$ はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい飽和または不飽和 3 ~ 7 員環を形成する]

30

の化合物；ならびに該化合物の栽培学的に許容される塩、異性体およびエナンチオマーに関する。

【発明を実施するための最良の形態】

【0005】

置換基の定義において現れるアルキル基は、直鎖または分岐のものでよく、例えば、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、さらにペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニルおよびデシル異性体である。高級アルキル基、特に 11 ~ 25 の炭素原子数、好ましくは 11、15、17、19 および 23 の炭素原子数を有する高級アルキル基は、好ましくは、分岐していないものである。それらは、好ましくはそれらが隣接するカルボニル基に対して 1 個以上の $C_1 - C_4$ アルキル基、特にメチル、エチルまたはイソプロピルによって置換されてよい。ハロアルキルは、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、ペンタフルオロエチル、1, 1-ジフルオロ-2, 2, 2-トリクロロエチル、2, 2, 3, 3-テトラフルオロエチルおよび 2, 2, 2-トリクロロエチル；好ましくは、トリクロロメチル、ジフルオロクロロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチルおよびジクロロフルオロメチルである。アルコキシアルキルは、例えば、メトキシメチル、エトキシメチル、プロポキシエチル、イソプロポキシエチル、*n*-ブトキシメチル、イソブトキシ-*n*-ブチル、*sec*-ブトキシメチルおよび *tert*-ブトキシ-イソプロピルであり、好ましくはメトキシメチ

40

50

ルおよびエトキシエチルである。アルコキシ、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、アルキルチオ、アルキルスルホニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルキルアミノアルキル、フェニルアルキル、ニトロアルキル、アミノアルキルおよびN-アルコキシ-カルボニル-N-アルキルアミノアルキル基は、上述したアルキル基から誘導される。アルケニルおよびアルキニル基は、一不飽和でも多不飽和でもよい。アルケニルとは、例えば、ビニル、アリル、メタリル、1-メチルビニルまたはブト-2-エン-1-イルであると理解される。高級アルケニル基、特に11~25の炭素原子数、好ましくは17または19の炭素原子数を有する高級アルキル基は、好ましくは、分岐していないものである。それらは、好ましくはそれらが隣接するカルボニル基に対して1位で、1個以上のC₁-C₄アルキル基、特にメチル、エチルまたはイソプロピルによって置換されてよい。それらのアルケニル基のうち、特に好ましいのはシス(cis)配置の単一の二重結合を含むものである。アルキニルは、例えば、エチニル、プロパルギル、ブト-2-イン-1-イル、2-メチルブチン-2-イルまたはブト-3-イン-2-イルである。ハロアルキル基は、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、ペンタフルオロエチル、1,1-ジフルオロ-2,2,2-トリクロロエチル、2,2,3,3-テトラフルオロエチルおよび2,2,2-トリクロロエチル；好ましくはトリクロロメチル、ジフルオロクロロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチルおよびジクロロフルオロメチルである。ハロアルケニルとしては、モノ-またはポリ-ハロ置換アルケニル基が適しており、ハロゲンハロゲンはフッ素、塩素、臭素またはヨウ素、特にフッ素または塩素であり、例えば、2,2-ジフルオロ-1-メチルビニル、3-フルオロプロペニル、3-クロロプロペニル、3-プロモプロペニル、2,3,3-トリフルオロプロペニル、2,3,3-トリクロロプロペニルおよび4,4,4-トリフルオロブト-2-エン-1-イルである。モノ-、ジ-またはトリ-ハロ置換C₂-C₆アルケニル基のうち、好ましいのは3~5炭素原子鎖長を有するものである。アルコキシ基は、好ましくは、1~6炭素原子鎖長を有する。アルコキシは、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシおよびtert-ブトキシ、さらにペンチルオキシおよびヘキシルオキシ異性体であり、好ましくはメトキシおよびエトキシである。アルコキシカルボニルは、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、n-ブトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、sec-ブトキシカルボニルまたはtert-ブトキシカルボニルであり、好ましくはメトキシカルボニルまたはエトキシカルボニルである。アルキルチオは、好ましくは、1~4炭素原子鎖長を有する。アルキルチオは、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ、イソブチルチオ、sec-ブチルチオまたはtert-ブチルチオであり、好ましくはメチルチオおよびエチルチオである。アルキルスルフィニルは、例えば、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル、n-ブチルスルフィニル、イソブチルスルフィニル、sec-ブチルスルフィニルまたはtert-ブチルスルフィニルであり、好ましくはメチルスルフィニルおよびエチルスルフィニルである。アルキルスルホニルは、例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、n-ブチルスルホニル、イソブチルスルホニル、sec-ブチルスルホニルまたはtert-ブチルスルホニルであり、好ましくはメチルスルホニルおよびエチルスルホニルである。アルキルアミノは、例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、イソプロピルアミノまたはブチルアミノ異性体である。ジアルキルアミノは、例えば、ジメチルアミノ、メチルエチルアミノ、ジエチルアミノ、n-プロピルメチルアミノ、ジブチルアミノおよびジイソプロピルアミノである。アルコキシアルキル基は、好ましくは、炭素原子数1~6を有する。アルコキシアルキルは、例えば、メトキシメチル、メトキシエチル、エトキシメチル、エトキシエチル、n-プロポキシメチル、n-プロポキシエチル、イソプロポキシメチルまたはイソプロポキシエチルである。アルキルチオアルキルは

、例えば、メチルチオメチル、メチルチオエチル、エチルチオメチル、エチルチオエチル、*n*-プロピルチオメチル、*n*-プロピルチオエチル、イソプロピルチオメチル、イソプロピルチオエチル、ブチルチオメチル、ブチルチオエチルまたはブチルチオブチルである。フェニルは、置換された形であってよく、その場合に置換基はオルト位、メタ位および/またはパラ位のいずれでもよい。好ましい置換基の位置は、環結合位置に対してオルト位およびパラ位である。

【0006】

アリールは、例えば、フェニルまたはナフチルである。これらの基は置換されてもよい。フェニル（フェニルアルキル等のような置換基の一部としてのフェニルを含む）は、置換されてよく、例えば、定義において特に示さない場合、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホキシ、カルボニル、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニル、アミノ、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノにより又は $C_1 - C_4$ アルキルカルボニルアミノにより置換されてよい。

10

【0007】

ヘテロアリール基は、通常、窒素、硫黄および酸素等のようなヘテロ原子を好ましくは1～3個含有する芳香族ヘテロ環である。適したヘテロ環およびヘテロ芳香族化合物の例は：ピロリジン、ピペリジン、ピラン、ジオキサン、アゼチジン、オキセタン、ピリジン、ピリミジン、トリアジン、チアゾール、チアジアゾール、イミダゾール、オキサゾール、イソオキサゾールおよびピラジン、フラン、モルホリン、ピペラジン、ピラゾール、ベンズオキサゾール、ベンズチアゾール、キノキサリンおよびキノリンである。それらのヘテロ環およびヘテロ芳香族化合物は更に置換されてよく、例えば、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、チオアルキル、アルキルアミノにより又はフェニルにより置換されてよい。

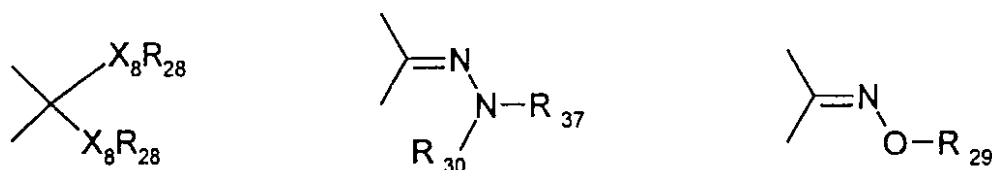
20

【0008】

本発明との関連において、3～7員環は、炭素原子に加えて、そして置換基Qの環に既に存在し得るあらゆるヘテロ原子に加えて、窒素、酸素および/または硫黄等のような1個以上のヘテロ原子を含有し得る環系であると理解される。それらは飽和でも不飽和でもよい。例えば、基 Q_2 の場合に、不飽和結合は置換基 R_6 および R_7 により形成されてよい。このような環系は、好ましくは、5～7環原子を含有する。シクロアルキル例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチルおよびシクロオクチルを包含する3～7員環も、置換されてよい。適した置換基は、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_4$ アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、ケト、 $C_2 - C_4$ アルケニルオキシアミノ、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルコキシアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、または下記：

30

【化4】



40

[式中、 X_8 は硫黄または酸素であり、 R_{28} は $C_1 - C_4$ アルコキシであるか、あるいは両方の R_{28} がそれらの結合する $-X_8-C-X_8-$ 架橋と一緒にあって、メチル、エチル、メトキシにより又はケト基により置換されてよい5または6員環を形成し、

R_{29} は $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニルまたは C_2

50

- C₄ ハロアルケニルであり、

R₃₀ および R₃₇ は各々他とは独立して、C₁ - C₄ アルキル、フェニルまたは C₂ - C₄ アルケニルであり、あるいは R₃₀ および R₃₇ はそれらが結合する窒素原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択されるヘテロ原子を含有してよい 5 または 6 員環を形成する]

により表わされる 3 基のうちの 1 つである。

【0009】

置換基の定義において、炭素原子数は、アルキル、アルケニルおよびアルキニル基ならびにこれらから誘導される基、例えばハロアルキルまたはアルケニルオキシ等、の中の炭素原子の総数を示す。従って、C₂ - C₃ アルコキシアリルは、メトキシメチル、メトキシエチルおよびエトキシメチルを包含する。C₃ アルコキシカルボニルアルキルは、メトキシカルボニルエチルおよびエトキシカルボニルメチルを包含する。

10

【0010】

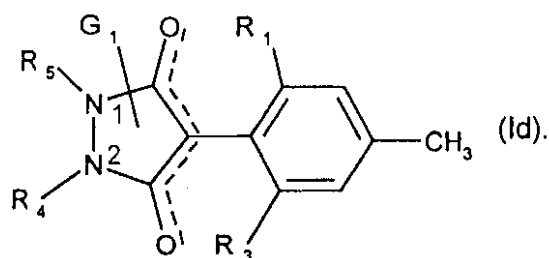
式 I の化合物は、置換基の性質により、幾何異性体および / または光学異性体および異性体混合物として、ならびに互変異生体および互変異性体混合物としても存在し得る。本発明は同様に式 I の化合物にも関する。

【0011】

例えば、R₄ および R₅ により一緒に形成される環が、非対称に置換され、縮合され又はスピロ結合される場合に、式 I の化合物は、例えば、下記式 I d :

【化 5】

20



30

により表わされる異性体として存在し得る。

【0012】

本発明は、式 I の化合物が好ましくはアミン、アルカリ金属およびアルカリ土類金属塩基または第 4 級アンモニウム塩基とともに形成可能な塩にも関する。適した塩は、例えば国際公開公報 WO 98 / 41089 に記載されている。

【0013】

本発明は、式 I の化合物がアミン、アルカリ金属およびアルカリ土類金属塩基または第 4 級アンモニウム塩基とともに形成可能な塩にも関する。塩形成剤としてのアルカリ金属およびアルカリ土類金属水酸化物のうち、リチウム、ナトリウム、カリウム、マグネシウムおよびカルシウムの水酸化物、特にナトリウムおよびカリウムの水酸化物が特に言及されるべきである。

40

【0014】

アンモニウム塩形成に適したアミンの例としては、アンモニア、ならびに第 1 級、第 2 級および第 3 級 C₁ - C₁₈ アルキルアミン、C₁ - C₄ ヒドロキシアリルアミンおよび C₂ - C₄ アルコキシアリルアミン、例えば、メチルアミン、エチルアミン、n - プロピルアミン、イソプロピルアミン、4 種のブチルアミン異性体、n - アミルアミン、イソアミルアミン、ヘキシルアミン、ヘプチルアミン、オクチルアミン、ノニルアミン、デシルアミン、ペンタデシルアミン、ヘキサデシルアミン、ヘプタデシルアミン、オクタデシルアミン、メチル - エチルアミン、メチル - イソプロピルアミン、メチル - ヘキシルアミ

50

ン、メチル - ノニルアミン、メチル - ペンタデシルアミン、メチル - オクタデシルアミン、エチル - ブチルアミン、エチル - ヘプチルアミン、エチル - オクチルアミン、ヘキシル - ヘプチルアミン、ヘキシル - オクチルアミン、ジメチルアミン、ジエチルアミン、ジ - n - プロピルアミン、ジイソプロピルアミン、ジ - n - ブチルアミン、ジ - n - アミルアミン、ジイソアミルアミン、ジヘキシルアミン、ジヘプチルアミン、ジオクチルアミン、エタノールアミン、n - プロパノールアミン、イソプロパノールアミン、N, N - ジエタノールアミン、N - エチルプロパノールアミン、N - ブチルエタノールアミン、アリルアミン、n - ブテニル - 2 - アミン、n - ペンテニル - 2 - アミン、2, 3 - ジメチルブテニル - 2 - アミン、ジブテニル - 2 - アミン、n - ヘキシル - 2 - アミン、プロピレンジアミン、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリ n - プロピルアミン、トリイソプロピルアミン、トリ n - ブチルアミン、トリイソブチルアミン、トリ sec - ブチルアミン、トリ n - アミルアミン、メトキシエチルアミンおよびエトキシエチルアミン；ヘテロ環アミン、例えば、ピリジン、キノリン、イソキノリン、モルホリン、ピペリジン、ピロリジン、インドリン、キヌクリジンおよびアセピン；第 1 級アリールアミン、例えば、アニリン、メトキシアニリン、エトキシアニリン、o - , m - および p - トルイジン、フェニレンジアミン、ベンジジン、ナフチルアミン、ならびに o - , m - および p - クロロアニリンが挙げられ、特にトリエチルアミン、イソプロピルアミンおよびジイソプロピルアミンが挙げられる。

【0015】

塩形成に適した好ましい第 4 級アンモニウム塩基は、例えば、式 $[N(R_a R_b R_c R_d)]OH$ に相当するものであり、式中、 R_a , R_b , R_c および R_d は各々他とは独立して $C_1 - C_4$ アルキルである。他の陰イオンとともに他の適したテトラアルキルアンモニウム塩基は、例えば、陰イオン交換反応により得ることができる。

【0016】

式 I の化合物のうち好ましいのは Q が Q_1 である化合物である。

【0017】

更に好ましい式 I の化合物は、 R_4 および R_5 が各々他とは独立して、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_2 - C_6$ アルコキシアリル、 $C_4 - C_6$ アルケニルオキシアリル、 $C_4 - C_6$ アルキニルオキシアリル、 $C_2 - C_6$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_6$ アルキルスルホキシルアルキル、 $C_2 - C_6$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_6$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 - C_6 - N$ - アルコキシ - イミノアルキル、 $C_3 - C_6$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_1 - C_6$ アミノアルキル、 $C_2 - C_6$ ジアルキルアミノアルキル、 $C_3 - C_6$ アルキニルアミノアルキル、 $C_1 - C_6$ シアノアルキル、 $C_4 - C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_7 - C_8$ フェニルアルキル、 $C_7 - C_8$ ヘテロアリールアルキル、 $C_7 - C_8$ フェノキシアリル、 $C_7 - C_8$ ヘテロアリールオキシアリル、 $C_4 - C_6$ アルキリデンアミノオキシアリル、 $C_1 - C_6$ ニトロアルキル、 $C_4 - C_8$ トリアルキルシリルアルキル、 $C_4 - C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 - C_6$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 - C_8$ アルキルアミノカルボニルオキシアリル、 $C_4 - C_8$ ジアルキルアミノカルボニルオキシアリル、 $C_4 - C_8$ アルコキシカルボニルアミノアルキル、 $C_4 - C_8 - N$ - アルコキシカルボニル - N - アルキルアミノ - アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、あるいは、

R_4 および R_5 はそれらが結合する原子と一緒にあって、5 ~ 7 員環を形成する、化合物である。

【0018】

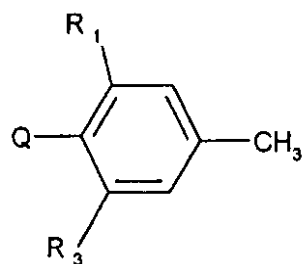
特に好ましい式 I の化合物は、 R_1 および R_3 が各々他とは独立して、エチル、ハロエチル、エチニル、 $C_1 - C_2$ アルコキシ、 $C_1 - C_2$ ハロアルコキシまたは $C_1 - C_2$ アルキルカルボニルであり；Q が基 Q_1 であり、式中、 G_1 は $-C(O)-R_{20}$ であり、式中、 R_{20} は $C_9 - C_{25}$ アルキル、1 個以上の $C_1 - C_4$ アルキル基により置換された $C_9 - C_{25}$ アルキル、 $C_9 - C_{25}$ アルケニル、または 1 個以上の $C_1 - C_4$ アルキル基により置換された $C_9 - C_{25}$ アルケニルであり、そして R_4 および R_5 はそれらが結合する原子

と一緒に、窒素、硫黄および特に酸素より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含有してよい 5 ~ 7 員環を形成する、化合物である。

【 0 0 1 9 】

式 I の化合物は、それ自体知られている方法に従って、下記式 I I :

【 化 6 】



(II),

10

[式中、 R_1 および R_3 は式 I について定義された通りであり、 Q は Q_1 、 Q_2 、 Q_3 、 Q_4 、 Q_5 、 Q_6 、 Q_7 、 Q_8 、 Q_9 または Q_{10} であり、式中、置換基 G_1 、 G_2 、 G_3 、 G_4 、 G_5 、 G_6 、 G_7 、 G_8 、 G_9 および G_{10} は水素である]

の化合物を、不活性溶媒および塩基の存在下で、下記式 I I I :

20

$Hal - G$

(I I I)

[式中、 Hal は塩素、臭素またはヨウ素であり、 G は $-C(X_1) - R_{20}$ 、 $-C(X_2) - X_3 - R_{21}$ 、 $-C(X_4) - N(R_{22}) - R_{23}$ 、 $-SO_2 - R_{24}$ 、 $-S(R_{200})_3$ 、 $-N(R_{300})_4$ 、 $-P(R_{400})_4$ 、 $-P(X_5)(R_{25}) - R_{26}$ または $-CH_2 - X_6 - R_{27}$ であり、式中、 X_1 、 X_2 、 X_3 、 X_4 、 X_5 および X_6 、ならびに R_{20} 、 R_{21} 、 R_{22} 、 R_{23} 、 R_{24} 、 R_{200} 、 R_{300} 、 R_{400} 、 R_{25} 、 R_{26} および R_{27} は定義された通りである]

の化合物と反応させることにより調製することができる。

【 0 0 2 0 】

式 I I の化合物は、例えば、国際公開公報 WO 0 1 / 1 7 9 7 2 に記載されている。式 I I I の化合物も知られており、これらの化合物は例えばメタル化反応などの通常の方法によりアルキル化することができる。

30

【 0 0 2 1 】

適した塩基は、例えば、トリメチルアミンおよびトリエチルアミン等のようなアミン、リン酸三アルカリ金属塩、アルカリ金属およびアルカリ土類金属水酸化物、アルカリ金属およびアルカリ土類金属アミドまたはアルカリ金属アルコラート、例えば、リン酸三カリウム、水素化ナトリウム、リチウムジイソプロピルアミド (LDA)、ナトリウム *tert* - ブタノラートまたはカリウム *tert* - ブタノラートである。特に好ましいのは、トリメチルアミンである。

【 0 0 2 2 】

適当な場合には、酸ハロゲン化物の活性を増大させる触媒、例えば 4 - N , N - ジメチルアミノピリジンを、式 I の化合物の調製に使用してもよい。

40

【 0 0 2 3 】

適した溶媒は、例えば、芳香族炭化水素、例えばキシレンまたはトルエン等、エーテル、例えばテトラヒドロフラン、ジオキサンまたはエチレングリコールジメチルエーテル等、ジメチルスルホキシド、あるいは第 3 級アミド、例えばジメチルホルムアミド、N - メチルピロリジノンまたはジメチルアセトアミド等、あるいはアクリル系尿素、例えば N , N' - ジメチルプロピレン尿素等である。

【 0 0 2 4 】

式 I の化合物またはそれらを含む組成物の本発明に従う使用として、農業において通例

50

である適用方法の全て、例えば出芽前適用、出芽後適用および種子被覆(seed-dressing)、ならびに様々な方法および技術、例えば活性成分の徐放(controlled-release)が考慮に入れられる。その目的のために、活性成分の溶液がミネラル顆粒担体または重合化顆粒(尿素/ホルムアルデヒド)に適用され、乾燥される。必要な場合、コーティング(被覆顆粒)を適用することも可能であり、このことは活性成分が特定の期間にわたって一定量で放出されることを可能にする。

【0025】

式Iの化合物は、未修正の形態すなわち合成で得られたままの形態において除草剤として使用してよいが、配合技術、例えば乳化可能な濃縮物、直接スプレー可能な又は希釈可能な溶液、希釈エマルジョン、湿潤可能な粉(powder)、溶解可能な粉、微粉(dust)、顆粒(granule)またはマイクロカプセル等への調製、に通常使用される助剤と一緒に通常の方法で配合されることが好ましい。このような配合物は、例えば、国際公開公報WO97/34485号の第9頁~13頁に記載されている。組成物の性質により、スプレー、噴霧、粉付け、湿潤、拡散(scattering)または流し込み(pouring)等の適用方法が、所期の目的および普及状況に従って選ばれる。

10

【0026】

式Iの化合物(活性成分)または少なくとも1種の式Iの化合物と、通常、1種以上の固形または液状配合助剤とを含んでなる、配合物すなわち組成物、調製物または混合物は、既知の方法、例えば活性成分と配合助剤、例えば、溶媒または固形担体との均一混合および/または粉碎によって調製される。界面活性化合物(界面活性剤)も、配合物の調製において加えて使用し得る。溶媒および固形担体の例は、例えば、国際公開公報WO97/34485号の第6頁に記載されている。

20

【0027】

配合されるべき式Iの化合物の性質により、適した界面活性剤は、良好な乳化性、分散性および湿潤性をもった非イオン性、陽イオン性および/または陰イオン性界面活性剤である。適した陰イオン性、非イオン性および陽イオン性界面活性剤の例は、例えば、国際公開公報WO97/34485号の第7頁および8頁に記載されている。これに加えて、とりわけ"McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual" MC Publishing Corp., Ridgewood, New Jersey, 1981, Stache, H., "Tensid-Taschenbuch", Carl Hanser Verlag, Munich/Vienna 1981, およびM. and J. Ash, "Encyclopedia of Surfactants", Vol. I-II, Chemical Publishing Co., New York, 1980-81に記載されている、配合技術で通常使用されている界面活性剤も、本発明による除草剤組成物の調製に適している。

30

【0028】

除草剤として有効な量の式Iの化合物を含有する本発明に従う除草および植物生長阻害組成物の活性は、スプレータンク助剤を添加することにより増大させることができる。このようなスプレータンク助剤としては、例えば、非イオン性界面活性剤、非イオン性界面活性剤の混合物、陰イオン性界面活性剤と非イオン性界面活性剤との混合物、陽イオン性界面活性剤、有機ケイ素系界面活性剤、界面活性剤を伴う及び伴わないミネラルオイル誘導体、界面活性剤の添加を伴う及び伴わない植物オイル誘導体、界面活性剤を伴う及び伴わない植物または鉱物由来のオイルのアルキル化誘導体、魚油および天然の動物である他の動物オイル、また界面活性剤を伴う及び伴わないそれらのアルキル誘導体、天然に産生する好ましくは炭素原子数8~28を含有する高級脂肪酸、ならびにそれらのアルキルエステル誘導体、1種以上のカルボン酸エステルおよび芳香族環系を含有する有機酸、さらにそれらのアルキル誘導体、ならびに酢酸ビニルポリマーまたは酢酸ビニル/アクリル酸エステルコポリマーの懸濁体がある。個々の助剤の他の助剤との混合物、および有機溶媒と組み合わせた混合物は、作用を更に増大させることができる。

40

【0029】

適した非イオン性界面活性剤は、例えば、脂肪族または脂環族アルコールの、飽和または不飽和脂肪酸の、及びアルキルフェノールの、ポリグリコールエーテル誘導体であり、これらは好ましくは、該(脂肪族)炭化水素基中に3~30のグリコールエーテル基およ

50

び 8 ~ 20 の炭素原子、および該アルキルフェノールのアルキル基中に 6 ~ 18 の炭素原子を含有してよい。

【0030】

更に適した非イオン性界面活性剤は、ポリエチレンオキシドと、ポリプロピレングリコール、エチレンジアミノプロピレングリコール、アルキルポリプロピレングリコール（該アルキル鎖中に好ましくは 1 ~ 10 炭素原子を含有するもの）との水溶性付加体であり、これら付加体は 20 ~ 250 のエチレングリコールエーテル基および 10 ~ 100 のプロピレングリコールエーテル基を含有する。これらの化合物は、通常、プロピレングリコールユニット当たり 1 ~ 5 のエチレングリコールユニットを含有する。

【0031】

言及し得る非イオン性界面活性剤の更なる例としては、ノニルフェノールポリエトキシエタノール、ヒマシ油ポリグリコールエーテル、ポリプロピレンノポリエチレンオキシド付加体、トリブチルフェノキシポリエトキシエタノール、ポリエチレングリコールおよびオクチルフェノキシポリエトキシエタノールが挙げられる。

【0032】

更に、例えばポリオキシエチレンソルビタントリオレート等のようなポリオキシエチレンソルビタンの脂肪酸エステルも、考慮される。

【0033】

陰イオン性界面活性剤のうち、特に、好ましいのは、アルキルサルフェート、アルキルスルホネート、アルキルアリアルスルホネートおよびアルキル化リン酸、それらのエトキシ化誘導体である。アルキル基は、通常、8 ~ 24 の炭素原子数を有する。

【0034】

好ましい非イオン性界面活性剤は、以下の商品名で知られている：ポリオキシエチレンココアルキルアミン（例えば、AMIET（登録商標）105（花王））、ポリオキシエチレンオレイルアミン（例えば、AMIET（登録商標）415（花王））、ノニルフェノールポリエトキシエタノール、ポリオキシエチレンステアリルアミン（例えば、AMIET（登録商標）320（花王））、N - ポリエトキシエチルアミン（例えば、GENAMIN（登録商標）（Hoechst AG））、N, N, N', N' - テトラ（ポリエトキシポリプロポキシエチル）エチレン - ジアミン（例えば、TERRONIL（登録商標）および TETRONIC（登録商標）（BASF Wyandotte Corp.））、BRIJ（登録商標）（Atlas Chemicals）、ETHYLAN（登録商標）CDおよび ETHYLAN（登録商標）D（Diamond Shamrock）、GENAPOL（登録商標）C、GENAPOL（登録商標）O、GENAPOL（登録商標）Sおよび GENAPOL（登録商標）X080（Hoechst AG）、EMULGEN（登録商標）104P、EMULGEN（登録商標）109P、EMULGEN（登録商標）408P（花王）；DISTY（登録商標）125（Geronazzo）、SOPROPHOR（登録商標）CY 18（Rhone Poulenc S.A.）；NONISOL（登録商標）（Ciba-Geigy）、MYRJ（登録商標）（ICI）；TWEEN（登録商標）（ICI）；EMULSOGEN（登録商標）（Hoechst AG）；AMIDOX（登録商標）（Stephan Chemical CO.,）；ETHOMID（登録商標）（Armak Co.,）；PLURONIC（登録商標）（BASF Wyandotte Corp.）；SOPROPHOR（登録商標）461P（Rhone Poulenc S.A.）、SOPROPHOR（登録商標）496/P（Rhone Poulenc S.A.）、ANTAROX FM-63（Rhone Poulenc S.A.）、SLYGARD 309（Dow Corning）、SILWET 408、SILWET L-7607N（Osi-Specialities）。

【0035】

陽イオン性界面活性剤は、特に、N - 置換基として 8 ~ 22 の炭素原子数を有する少なくとも 1 つのアルキル基を含有し、かつ更なる置換基として低級の未置換またはハロゲン化されたアルキル、ベンジルあるいはヒドロキシ低級アルキル基を有する第 4 級アンモニウム塩である。この塩は、好ましくは、ハロゲン化物、メチルサルフェートまたはエチルサルフェートの形態であり、例えば、塩化ステアリルトリメチルアンモニウムまたは臭化ベンジルジ（2 - クロロエチル）エチルアンモニウムである。

【0036】

使用されるオイルは、鉱物または天然由来のいずれかのものでよい。天然オイルはさらに、動物または植物由来のものでよい。動物オイルの場合に、特に好ましいのは牛脂（ta

10

20

30

40

50

flow) 誘導体であるが、魚油 (例えばイワシ油) およびその誘導体も好ましい。植物オイルは、通常、様々な由来の種油である。特に使用される植物オイルの例として、ココナッツ油、ナタネ油、ヒマワリ油およびそれらの誘導体が言及され得る。

【0037】

本発明による組成物において、用いられる添加物の量は、一般に、スプレー混合物を基準にして 0.01 ~ 2 % である。オイル添加物は、例えば、スプレー混合物を調製した後にスプレータンクに所望の濃度で添加し得る。

【0038】

本発明による組成物において、好ましいオイル添加物は、植物由来オイル、例えば、ナタネ油またはヒマワリ油、植物由来オイルのアルキルエステル、例えばメチル誘導体、またはミネラルオイルである。

10

【0039】

特に好ましいオイル添加物は、高級脂肪酸 ($C_8 - C_{22}$) のアルキルエステル、特に $C_{12} - C_{18}$ 脂肪酸のメチル誘導体、例えば、ラウリン酸、パルミチン酸およびオレイン酸のメチルエステルである。これらのエステルは、ラウリン酸メチル (CAS-111-82-0)、パルミチン酸メチル (CAS-112-39-0)、オレイン酸メチル (CAS-112-62-9) として知られている。

【0040】

オイル添加物の適用および作用は、それらを界面活性物質、例えば非イオン性、陰イオン性または陽イオン性界面活性剤と混ぜ合わせることによって改善することができる。適した陰イオン性、非イオン性および陽イオン性界面活性剤の例は、国際公開公報 WO 97 / 34485 号の第 7 頁および 8 頁に列挙されている。

20

【0041】

好ましい界面活性物質は、ドデシルベンゼンスルホン酸型の陰イオン性界面活性剤、特にそれらのカルシウム塩、さらに脂肪アルコールエトキシレート型の非イオン性界面活性剤である。特に好ましいのは、エトキシ化度が 5 ~ 40 のエトキシ化 $C_{12} - C_{22}$ 脂肪アルコールである。商業的に入手できる好ましい界面活性剤の例は、ゲナポール (Genapol) タイプ (Clariant AG, Muttenz, Switzerland) である。全添加物を基準とした界面活性物質の濃度は、一般に、1 ~ 30 重量 % である。

【0042】

オイルまたはミネラルオイルまたはそれらの誘導体と界面活性剤との混合物からなるオイル添加物の例は、Edenor ME SU (登録商標)、Emery 2231 (登録商標) (Henkel 子会社 Cognis GmbH, DE)、Turbocharge (登録商標) (Zeneca Agro, Stoney Creek, Ontario, CA)、または更に好ましくは Actipron (登録商標) (BP Oil UK Limited, GB) である。

30

【0043】

オイル添加物 / 界面活性剤混合物への有機溶媒の添加は、さらに作用の更なる増大をもたらすことができる。適した溶媒は、例えば、Solvesso (登録商標) (ESS0) または Aromatic Solvent (登録商標) (Exxon Corporation) タイプである。

【0044】

それらの溶媒の濃度は、全重量の 10 ~ 80 % とすることができる。

40

【0045】

このようなオイル添加物 (これらは例えば米国特許 US - A - 4834908 にも記載されている) は、本発明による組成物のために特に好ましい。特に好ましいオイル添加物は商品名 MERGE (登録商標) で知られており、これは BASF Corporation より入手することができ、その基本説明が、例えば、US - A - 4834908 の第 5 欄に例 C O C - 1 として記載されている。本発明に従って好ましい更なるオイル添加物は SCORE (登録商標) (Novartis Crop Protection Canada) である。

【0046】

界面活性剤、オイル、特に植物油、アルキル化脂肪酸等のようなそれらの誘導体およびそれらの混合物、例えば、アルキル化リン酸、アルキル硫酸、アルキルアリアルスルホン

50

酸および高級脂肪酸等のような好ましくは陰イオン性界面活性剤（これらは配合及び助剤技術で通例であり本発明でも使用し得る）との混合物、ならびにそれらのスプレータンク溶液が、とりわけ"McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual" MC Publishing Corp., Ridgewood, New Jersey, 1981, Stache, H., "Tensid-Taschenbuch", Carl Hanser Verlag, Munich/Vienna, 1990, M. and J. Ash, "Encyclopedia of Surfactants", Vol. I-IV, Chemical Publishing Co., New York, 1981-89, G. Kapusta, "A Compendium of Herbicide Adjuvants", Southern Illinois Univ., 1998, L. Thomson Haevey, "A Guide to Agricultural Spray Adjuvants Used in the United States", Thomson Pubns., 1992に記載されている。

【0047】

10

除草剤配合物は、通常、0.1～99重量%、特に0.1～95重量%の除草剤、1～99.9重量%、特に5～99.8重量%の固形または液状の配合助剤、および0～25重量%、特に0.1～25重量%の界面活性剤を含有する。商業製品は通常は濃縮物として配合されるのに対し、最終消費者は通常は希釈配合物を用いることになる。組成物は、安定剤、例えば植物オイルまたはエポキシド化(epoxidised)植物オイル(エポキシド化ココナッツ油、ナタネ油または大豆油)、消泡剤、例えばシリコンオイル、保存剤、粘度調整剤、結合剤、粘着付与剤、さらに肥料または他の活性成分などのような成分を更にも含んでもよい。

【0048】

式Iの化合物は、一般に、植物またはその位置に対し0.001～4kg/ha、特に0.005～2kg/haの適用レートで適用される。所望される効果を達成するために必要な濃度は、実験により決定することができる。その濃度は、作用の性質、栽培植物と雑草の発育の段階および適用(場所、時間、方法)に依存し、これらのパラメータの関数として広い限度内で変動し得る。

20

【0049】

式Iの化合物は、除草および生長阻害特性によって識別され、それらの化合物を有用植物、特に穀類、綿、大豆、サトウダイコン、サトウキビ、プランテーション作物、セイヨウアブラナ、トウモロコシおよびイネ、の栽培に、さらに非選択的雑草抑制のために使用できるようにする。「作物」という用語は、従来の交配方法または遺伝子工学技術の結果として除草剤または除草剤のクラスに対して耐性とされている作物を包含するものとして理解すべきであり、これらは例えばIMIトウモロコシ、ポースト(poast)保護化トウモロコシ(セトキシジム耐性)、リバティリンク(liberty link)トウモロコシ、Bt/リバティリンクトウモロコシ、IMI/リバティリンクトウモロコシ、IMI/リバティリンク/Btトウモロコシ、ラウンドアップレディ(Roundup ready)トウモロコシおよびラウンドアップレディ/Btトウモロコシである。

30

【0050】

抑制されるべき雑草は、単子葉草でも双子葉草でもよく、例えば、ハコベ属(Stellaria)、ナスタチウム属(Nasturtium)、コヌカグサ属(Agrostis)、メヒシバ属(Digitaria)、アベナ属(Avena)、エイコログサ属(Setaria)、シナピス属(Sinapis)、ロリウム属(Lolium)、ナス属(Solanum)、ヒエ属(Echinochloa)、シルプス属(Scirpus)、ミズアオイ属(Monochoria)、サギタリア属(Sagittaria)、ブロームス属(Bromus)、スズメノテッポウ属(Alopecurus)、モロコシ属(Sorghum halepense)、ツノアイアシ属(Rottboellia)、シペラス属(Cyperus)、アブティロン属(Abutilon)、シダ属(Sida)、オナモミ属(Xanthium)、アマランツス属(Amaranthus)、アカザ属(Chenopodium)、イポメア属(Ipomoea)、クリサンセマム属(Chrysanthemum)、ヤエムグラ属(Galium)、スミレ属(Viola)およびペロニカ属(Veronica)が挙げられる。

40

【0051】

意外なことに、US-A-5041157号、US-A-5541148号、US-A-5006656号、EP-A-0094349号、EP-A-0551650号、EP-A-0268554号、EP-A-0375061号、EP-A-0174562号、

50

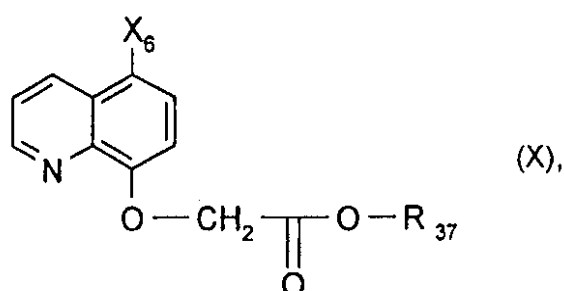
EP - A - 492366号、WO91/7874号、WO94/987号、DE - A - 19612943号、WO96/29870号、WO98/13361号、WO98/39297号、WO98/27049号、EP - A - 0716073号、EP - A - 0613618号、US - A - 5597776号、EP - A - 0430004号、DE - A - 4331448号、WO99/16744号、WO00/30447号およびWO00/00020号から公知である特定の毒性緩和剤(safener)が本発明に従う除草剤組成物との混合に適していることが見いだされた。従って、本発明は、有用植物の栽培、特にトウモロコシおよび穀類の栽培において、草および雑草を抑制するための選択的除草剤組成物であって、式Iの除草剤と、毒性緩和剤(対抗作用剤(counter-agent)、解毒剤(antidote))とを含んでなり、除草剤の植物毒素作用から有用植物を保護するが雑草を保護しない組成物、ならびに有用植物の栽培における雑草の抑制において該組成物を使用することにも関する。

10

【0052】

毒性緩和剤は、好ましくは、下記式X：

【化7】



20

[式中、R₃₇は水素、C₁-C₈アルキル、またはC₁-C₆アルコキシにより又はC₃-C₆アルケニルオキシにより置換されたC₁-C₈アルキルであり；X₇は水素または塩素である]

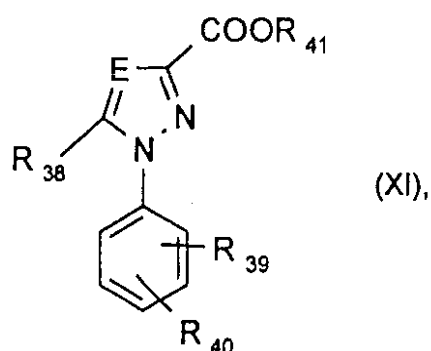
30

の化合物に相当するか；

あるいは、例えばスイス国特許出願2135/00および2066/01に記載されているような式Xの化合物の水和物または塩に相当するか；

あるいは、下記式XI：

【化8】



40

[式中、

Eは窒素またはメチンであり；

50

R_{38} は $-CCl_3$ 、フェニル、またはハロゲンにより置換されたフェニルであり；

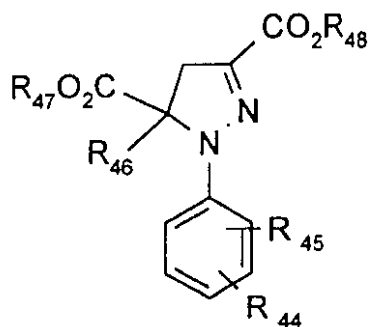
R_{39} および R_{40} は各々他とは独立して、水素またはハロゲンであり；そして

R_{41} は $C_1 - C_8$ アルキルである]

の化合物に相当するか；

あるいは、下記式 XII ：

【化 9】



(XII),

10

[式中、 R_{44} および R_{45} は各々他とは独立して、水素またはハロゲンであり；そして

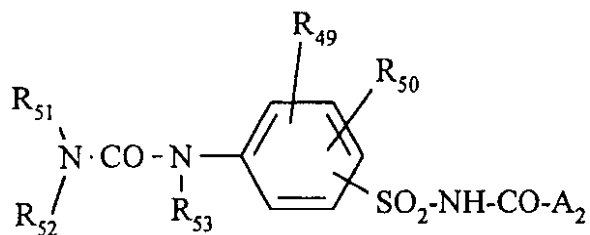
20

R_{46} 、 R_{47} および R_{48} は各々他とは独立して、 $C_1 - C_4$ アルキルである]

の化合物に相当するか；

あるいは、下記式 $XIII$ ：

【化 10】

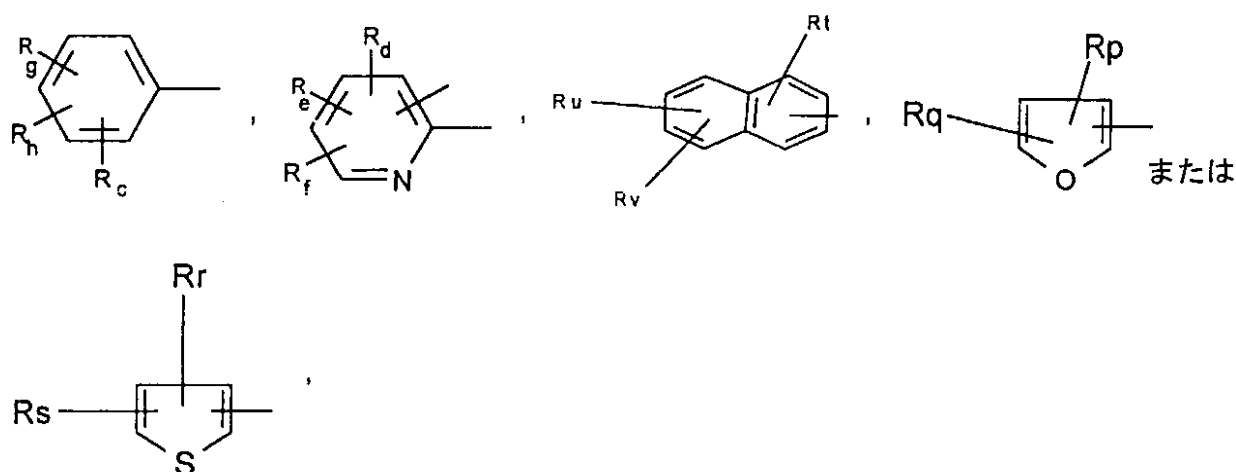


(XIII),

30

[式中、 A_2 は下記の基：

【化 1 1】



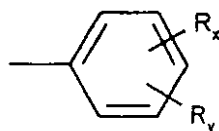
10

であり、

R_{51} および R_{52} は各々他とは独立して、水素、 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ アルケニル、 $C_3 - C_6$ アルキニル、

20

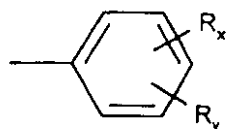
【化 1 2】



であるか、または $C_1 - C_4$ アルコキシにより又は下記：

30

【化 1 3】



により置換された $C_1 - C_4$ アルキルであり、あるいは R_{51} および R_{52} は一緒になって、酸素、硫黄、 SO 、 SO_2 、 NH により又は $-N(C_1 - C_4 \text{ アルキル})-$ により分断されてよい $C_4 - C_6$ アルキレン架橋を形成し；

40

R_{53} は水素または $C_1 - C_4$ アルキルであり；

R_{49} は水素、ハロゲン、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $-COOR_j$ 、 $-CONR_kR_m$ 、 $-COR_n$ 、 $-SO_2NR_kR_m$ または $-OSO_2 - C_1 - C_4$ アルキルであり；

R_9 は水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $-COOR_j$ 、 $-CONR_kR_m$ 、 $-COR_n$ 、 $-SO_2NR_kR_m$ または $-OSO_2$

50

- $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、あるいは $C_1 - C_4$ アルコキシにより又はハロゲンにより置換された $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_3 - C_6$ アルケニルオキシ、あるいはハロゲンにより置換された $C_3 - C_6$ アルケニルオキシ、または $C_3 - C_6$ アルキニルオキシであるか、あるいは R_{49} および R_{50} は一緒になって、ハロゲンにより又は $C_1 - C_4$ アルキルにより置換されてよい $C_3 - C_4$ アルキレン架橋を形成するか、あるいは一緒になってハロゲンにより又は $C_1 - C_4$ アルキルにより置換されてよい $C_3 - C_4$ アルケニレン架橋を形成するか、あるいは一緒になって、ハロゲンにより又は $C_1 - C_4$ アルキルにより置換されてよい C_4 アルカジエニレン架橋を形成し；

R_{50} および R_h は各々他とは独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、トリフルオロメチル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルチオまたは $-COOR_j$ であり； 10

R_c は水素、ハロゲン、ニトロ、 $C_1 - C_4$ アルキルまたはメトキシであり； R_d は水素、ハロゲン、ニトロ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $-COOR_j$ または $-CONR_k R_m$ であり；

R_e は水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $-COOR_j$ 、トリフルオロメチルまたはメトキシであり、あるいは R_d および R_e は一緒になって $C_3 - C_4$ アルキレン架橋を形成し；

R_p は水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $-COOR_j$ 、トリフルオロメチルまたはメトキシであり； R_q は水素、ハロゲン、ニトロ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $-COOR_j$ または $-CONR_k R_m$ であり；あるいは R_p および R_q は一緒になって $C_3 - C_4$ アルキレン架橋を形成し； 20

R_r は水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $-COOR_j$ 、トリフルオロメチルまたはメトキシであり； R_s は水素、ハロゲン、ニトロ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $-COOR_j$ または $-CONR_k R_m$ であり；あるいは R_r および R_s は一緒になって $C_3 - C_4$ アルキレン架橋を形成し；

R_t は水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $-COOR_j$ 、トリフルオロメチルまたはメトキシであり； R_u は水素、ハロゲン、ニトロ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $-COOR_j$ または $-CONR_k R_m$ であり；あるいは R_v および R_u は一緒になって $C_3 - C_4$ アルキレン架橋を形成し； 30

R_f および R_v は各々、水素、ハロゲンまたは $C_1 - C_4$ アルキルであり；

R_x および R_y は各々他とは独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $-COOR_{54}$ 、トリフルオロメチル、ニトロまたはシアノであり；

R_j 、 R_k および R_m は各々他とは独立して、水素または $C_1 - C_4$ アルキルであり；あるいは、

R_k および R_m は一緒になって、酸素、NHにより又は $-N(C_1 - C_4 \text{ アルキル}) -$ により分断されてよい $C_4 - C_6$ アルキレン架橋を形成し； 40

R_n は $C_1 - C_4$ アルキル、フェニル、あるいはハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、メトキシ、ニトロにより又はトリフルオロメチルにより置換されたフェニルであり；

R_{54} は水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ - $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ - $C_1 - C_4$ アルキル、ジ - $C_1 - C_4$ アルキルアミノ - $C_1 - C_4$ アルキル、ハロ - $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、ハロ - $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_3 - C_8$ アルキニル、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、ハロ - $C_3 - C_7$ シクロアルキル、 $C_1 - C_8$ アルキルカルボニル、アリルカルボニル、 $C_3 - C_7$ シクロアルキルカルボニル、あるいは3個までの同じか又は異なるハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、ハロ - $C_1 - C_4$ アルキル、ハロ - $C_1 - C_4$ アルコキシまたは $C_1 - C_4$ アルコキシ置換基によりフェニル環 50

上で置換された又は置換されていないベンゾイル；あるいはフロイル、チエニル；あるいはフェニル、ハロフェニル、 $C_1 - C_4$ アルキルフェニル、 $C_1 - C_4$ アルコキシフェニル、ハロ - $C_1 - C_4$ アルキルフェニル、ハロ - $C_1 - C_4$ アルコキシフェニル、 $C_1 - C_6$ アルコシカルボニル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ - $C_1 - C_8$ アルコシカルボニル、 $C_3 - C_8$ アルケニルオシカルボニル、 $C_3 - C_8$ アルキニルオシカルボニル、 $C_1 - C_8$ アルキルチオカルボニル、 $C_3 - C_8$ アルケニルチオカルボニル、 $C_3 - C_8$ アルキニルチオカルボニル、カルバモイル、モノ - $C_1 - C_4$ アルキルアミノカルボニル、ジ - $C_1 - C_4$ アルキルアミノカルボニルにより置換された $C_1 - C_4$ アルキル；あるいは3個までの同じか又は異なるハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、ハロ - $C_1 - C_4$ アルキル、ハロ - $C_1 - C_4$ アルコキシまたは $C_1 - C_4$ アルコキシ置換基により又は1個のシアノまたはニトロ置換基によりフェニル上で置換された又は置換されていないフェニルアミノカルボニル、あるいは1個または2個の $C_1 - C_4$ アルキル基により置換された又は置換されていないジオキソラン - 2 - イル、あるいは1個または2個の $C_1 - C_4$ アルキル基により置換された又は置換されていないジオキサン - 2 - イル、あるいはシアノ、ニトロ、カルボニルにより又は $C_1 - C_8$ アルキルチオ - $C_1 - C_8$ アルコシカルボニルにより置換された $C_1 - C_4$ アルキルである]

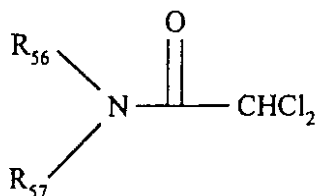
10

の化合物に相当するか；

あるいは、下記式 X I V：

【化 1 4】

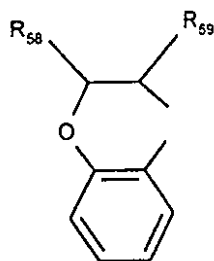
20



[式中、 R_{56} および R_{57} は各々他とは独立して、 $C_1 - C_6$ アルキルまたは $C_2 - C_6$ アルケニルであり；あるいは、 R_{56} および R_{57} は一緒になって下記：

30

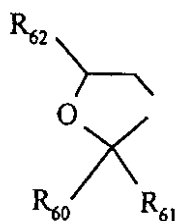
【化 1 5】



40

であり； R_{58} および R_{59} は各々他とは独立して、ハロゲンまたは $C_1 - C_6$ アルキルであり；あるいは、 R_{56} および R_{57} は一緒になって下記：

【化 1 6】



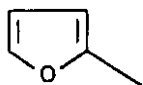
10

であり；

R_{60} および R_{61} は各々他とは独立して $C_1 - C_4$ アルキルであり、あるいは R_{60} および R_{61} は一緒になって $-(CH_2)_5-$ であり；

R_{62} は水素、 $C_1 - C_4$ アルキルまたは下記：

【化 1 7】

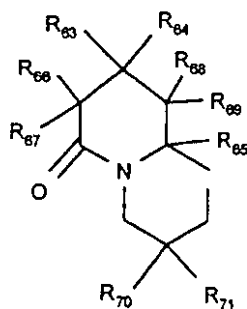


20

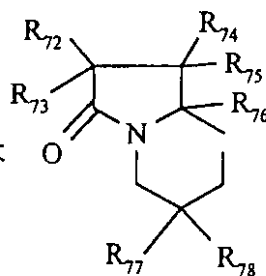
であり、あるいは、

R_{56} および R_{57} は一緒になって下記：

【化 1 8】



または



30

であり；

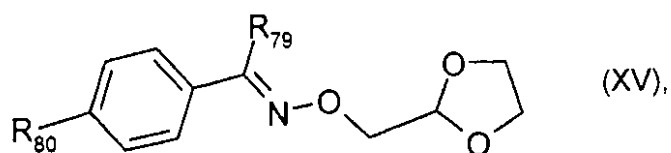
R_{63} , R_{64} , R_{65} , R_{66} , R_{67} , R_{68} , R_{69} , R_{70} , R_{71} , R_{72} , R_{73} , R_{74} , R_{75} , R_{76} , R_{77} および R_{78} は各々他とは独立して、水素または $C_1 - C_4$ アルキルである]

40

の化合物に相当するか；

あるいは、下記式 X V：

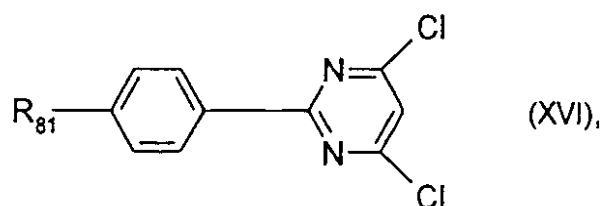
【化 19】



[式中、 R_{80} は水素または塩素であり、 R_{79} はシアノまたはトリフルオロメチルである] の化合物に相当するか； 10

あるいは、下記式 X V I：

【化 20】



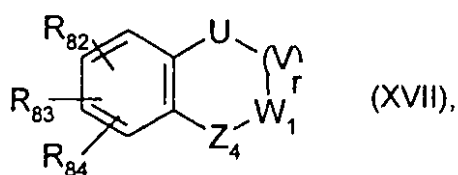
20

[式中、 R_{81} は水素またはメチルである]

の化合物に相当するか；

あるいは、下記式 X V I I：

【化 21】



30

[式中、 R_{82} は水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、あるいは $C_1 - C_4$ アルキル - X_2 - により又は $C_1 - C_4$ ハロアルキル - X_2 - により置換された $C_1 - C_4$ アルキルであるか、あるいは $C_1 - C_4$ ハロアルキル、ニトロ、シアノ、 $-COOR_{85}$ 、 $-NR_{86}R_{87}$ 、 $-SO_2R_{88}R_{89}$ または $-CONR_{90}R_{91}$ であり；

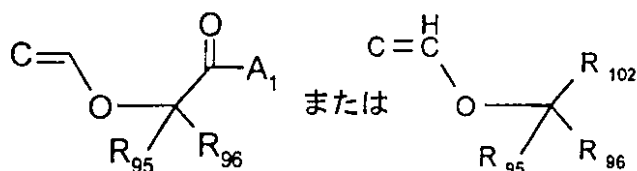
40

R_{83} は水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、トリフルオロメチル、 $C_1 - C_4$ アルコキシまたは $C_1 - C_4$ ハロアルコキシであり；

R_{84} は水素、ハロゲンまたは $C_1 - C_4$ アルキルであり；

U、V、 W_1 および Z_4 は各々他とは独立して、酸素、硫黄、 $C(R_{92})R_{93}$ 、カルボニル、 NR_{94} 、下記の基：

【化 2 2】

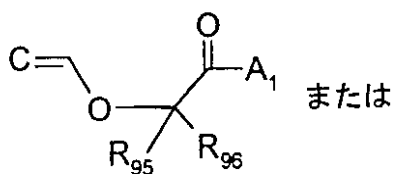


10

であり、式中、 R_{102} は $C_2 - C_4$ アルケニルまたは $C_2 - C_4$ アルキニルであるが；但し、以下：

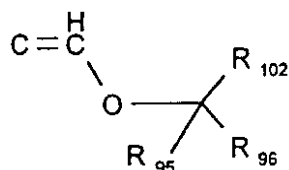
a) 環員 U、V、 W_1 または Z_4 の少なくとも 1 つがカルボニルであり、その又はそれらの環員に隣接する環員が下記の基：

【化 2 3】



20

【化 2 4】



30

であり、当該基が 1 回だけ存在すること；および

b) 2 つの隣接する環員 U および V、V および W_1 、ならびに W_1 および Z_4 が同時に酸素であることはできないことを条件とし；

R_{95} および R_{96} は各々他とは独立して、水素または $C_1 - C_8$ アルキルであり；あるいは、

R_{95} および R_{96} は一緒になって、 $C_2 - C_6$ アルケニレン基を形成し；

40

A_1 は $R_{99} - Y_1$ - または $-NR_{97}R_{98}$ であり；

X_2 は酸素または $-S(O)_s$ であり；

Y_1 は酸素または硫黄であり；

R_{99} は水素、 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ - $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_3 - C_8$ アルケニルオキシ - $C_1 - C_8$ アルキル、またはフェニル - $C_1 - C_8$ アルキル（該フェニル環がハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、トリフルオロメチル、メトキシにより又はメチル - $S(O)_s$ - により置換されてよい）であるか、あるいは $C_3 - C_6$ アルケニル、 $C_3 - C_6$ ハロアルケニル、フェニル - $C_3 - C_6$ アルケニル、 $C_3 - C_6$ アルキニル、フェニル - $C_3 - C_6$ アルキニル、オキセタニル、フリルまたはテトラヒドロフリルであり；

50

R_{85} は水素または $C_1 - C_4$ アルキルであり；

R_{86} は水素、 $C_1 - C_4$ アルキルまたは $C_1 - C_4$ アルキルカルボニルであり；

R_{87} は水素または $C_1 - C_4$ アルキルであり；あるいは、

R_{86} および R_{87} は一緒になって、 C_4 - または C_5 - アルキレン基を形成し；

R_{88} 、 R_{89} 、 R_{90} および R_{91} は各々他とは独立して、水素または $C_1 - C_4$ アルキルであり；あるいは、

R_{88} は R_{89} と一緒になって、または R_{90} は R_{91} と一緒になって、各々が他とは独立して、 C_4 - または C_5 - アルキレンであり、1個の炭素原子が酸素により又は硫黄により置換されているか、あるいは1個または2個の炭素原子が $-NR_{100}-$ により置換されてよく；

10

R_{92} 、 R_{100} および R_{93} は各々他とは独立して、水素または $C_1 - C_8$ アルキルであり；あるいは、

R_{92} および R_{93} は一緒になって、 $C_2 - C_6$ アルキレンであり；

R_{94} は水素または $C_1 - C_8$ アルキルであり；

R_{97} は水素、 $C_1 - C_8$ アルキル、フェニルまたはフェニル - $C_1 - C_8$ アルキル（該フェニル環がフッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、 $-OCH_3$ 、 $C_1 - C_4$ アルキルにより又は CH_3SO_2- により置換されていてよい）であるか、または $C_1 - C_4$ アルコキシ - $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_3 - C_6$ アルケニルまたは $C_3 - C_6$ アルキニルであり；

R_{98} は水素、 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_3 - C_6$ アルケニルまたは $C_3 - C_6$ アルキニルであり；あるいは

20

R_{97} および R_{98} は一緒になって、 C_4 - または C_5 - アルキレン基であり、1個の炭素原子が酸素により又は硫黄により置換されているか、あるいは1個または2個の炭素原子が $-NR_{101}-$ により置換されていてよく；

R_{101} は水素または $C_1 - C_4$ アルキルであり；

r は0または1であり；そして

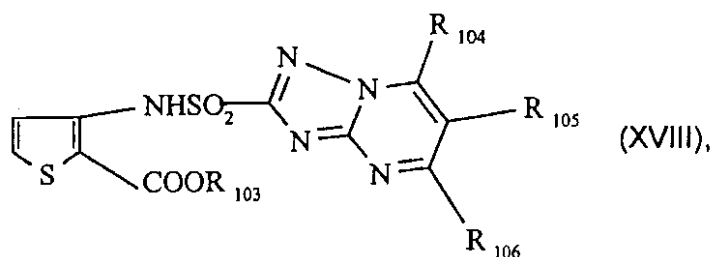
s は0、1または2である]

の化合物に相当するか；

あるいは、下記式XVIIII：

【化25】

30



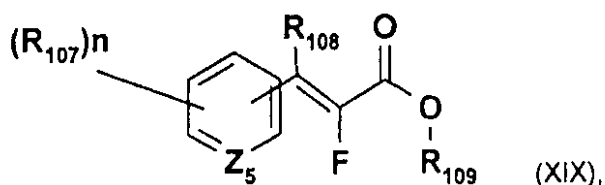
40

[式中、 R_{103} は水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルまたは $C_3 - C_6$ アルケニルまたは $C_3 - C_6$ アルキニルであり；そして、 R_{104} 、 R_{105} および R_{106} は各々他とは独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルまたは $C_1 - C_6$ アルコキシであるが、但し、置換基 R_{104} 、 R_{105} および R_{106} の1つが水素以外であることを条件とする]

の化合物に相当するか；

あるいは、下記式XIX：

【化 2 6】



10

[式中、 Z_5 はNまたはCHであり、 Z_5 がNである場合に n は 0、1、2 または 3 であり、 Z_5 がCHである場合に n は 0、1、2、3 または 4 であり、 R_{107} はハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、ニトロ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニル、フェニルまたはフェノキシ、あるいは $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたフェニルまたはフェノキシであり；

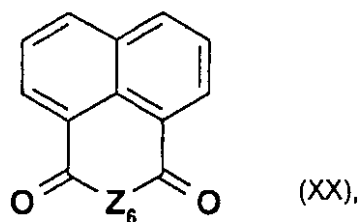
R_{108} は水素または $C_1 - C_4$ アルキルであり、 R_{109} は水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_2 - C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルケニルオキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルまたは $C_1 - C_4$ アルキニルオキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルである]

20

の化合物に相当するか；

あるいは、下記式 XX：

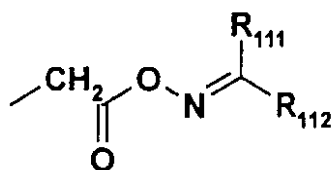
【化 2 7】



30

[式中、 Z_6 は酸素または N - R_{110} であり、 R_{110} は下記：

【化 2 8】



40

の基であり、

式中、 R_{111} および R_{112} は各々他とは独立して、シアノ、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、アリール、フェニルまたはヘテロア

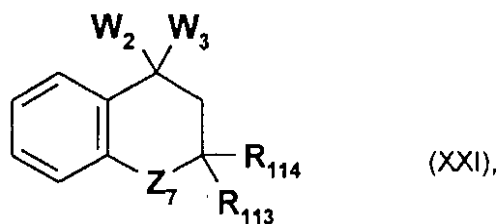
50

リール、あるいは $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたアリール、フェニルまたはヘテロアリールである]

の化合物に相当するか；

あるいは、下記式 XX I：

【化 2 9】



10

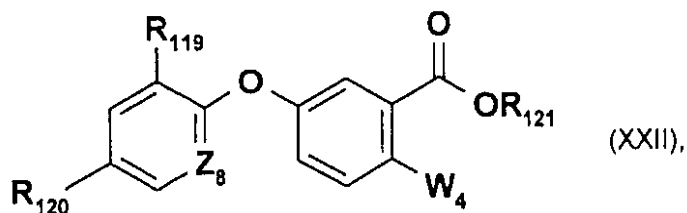
[式中、 Z_7 は酸素、硫黄、 $S=O$ 、 SO_2 または CH_2 であり、 R_{113} および R_{114} は各々他とは独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 - C_4$ アルキルであり、 W_2 および W_3 は各々他とは独立して、 CH_2COOR_{115} または $COOR_{0115}$ であるか、あるいは一緒になって式 $-(CH_2)C(O)-O-C(O)-(CH_2)-$ の基であり、 R_{115} および R_{0115} は各々他とは独立して、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、金属陽イオンまたはアンモニウム陽イオンである]；

20

の化合物に相当するか；

あるいは、下記式 XX II：

【化 3 0】

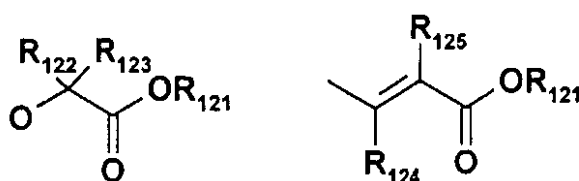


30

[式中、 R_{119} および R_{120} は各々他とは独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 - C_4$ ハロアルキルであり、 R_{120} は水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_3 - C_4$ アルケニル、 $C_3 - C_4$ アルキニル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、金属陽イオンまたはアンモニウム陽イオンであり、 Z_8 は N 、 CH 、 $C-F$ または $C-Cl$ であり、 W_4 は下記：

40

【化 3 1】



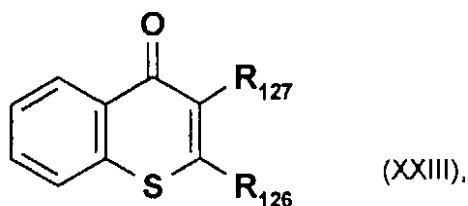
10

の基であり、

式中、 R_{122} および R_{123} は各々他とは独立して、水素または $C_1 - C_4$ アルキルであり、そして R_{124} および R_{125} は各々他とは独立して、水素または $C_1 - C_4$ アルキルである]

の化合物に相当するか；あるいは、下記式 XXIII：

【化 3 2】



20

[式中、 R_{126} は水素、シアノ、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_4$ アルキルチオカルボニル、 $-NH-R_{128}$ 、 $-C(O)NH-R_{0128}$ 、アリーールまたはヘテロアリーール、あるいは $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたアリーールまたはヘテロアリーールであり；

30

R_{127} は水素、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシまたは $C_1 - C_4$ チオアルキルであり、そして

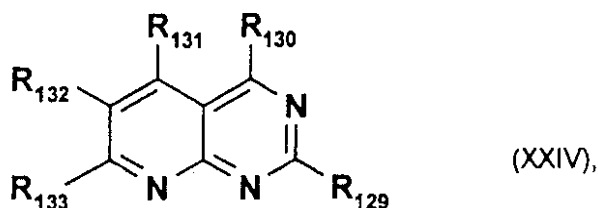
R_{128} および R_{0128} は各々他とは独立して、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_3 - C_4$ アルケニル、 $C_3 - C_4$ アルキニル、 $C_3 - C_4$ シクロアルキル、アリーールまたはヘテロアリーール、あるいは $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロ、ホルミル、 $C_1 - C_4$ アルキルカルボニルまたは $C_1 - C_4$ アルキルスルホニルにより置換されたアリーールまたはヘテロアリーールである]

40

の化合物に相当するか；

あるいは、下記式 XXIV：

【化 3 3】



10

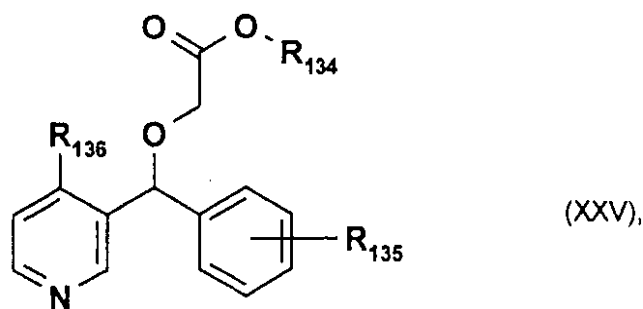
[式中、 R_{129} および R_{130} は各々他とは独立して、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、モノ - $C_1 - C_8$ - またはジ - $C_1 - C_8$ - アルキルアミノ、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ チオアルキル、フェニルまたはヘテロアリールであり、 R_{131} は R_{129} について定義された通りであり、加えて、 OH 、 NH_2 、ハロゲン、ジ - $C_1 - C_4$ アミノアルキル、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニルまたは $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニルであってもよく、 R_{132} は R_{129} について定義された通りであり、加えて、シアノ、ニトロ、カルボキシル、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニル、ジ - $C_1 - C_4$ アミノアルキル、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $SO_2 - OH$ 、イソ - $C_1 - C_4$ アミノアルキルスルホニルまたは $C_1 - C_4$ アルコキシスルホニルであってもよく、 R_{133} は R_{129} について定義された通りであり、加えて、 OH 、 NH_2 、ハロゲン、ジ - $C_1 - C_4$ アミノアルキル、ピロリジン - 1 - イル、ピペリジン - 1 - イル、モルホリン - 1 - イル、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニル、フェノキシ、ナフトキシ、フェニルアミノ、ベンゾイルオキシまたはフェニルスルホニルオキシである]

20

の化合物に相当するか；

あるいは、下記式 XXV：

【化 3 4】



30

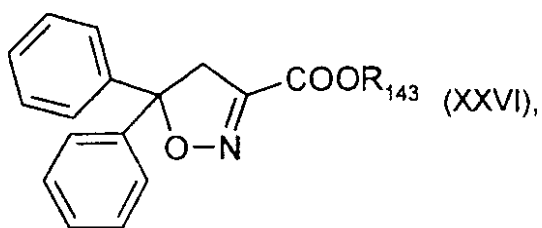
[R_{134} は水素、 C_4 アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニルまたは $C_1 - C_4$ アルコキシ - $C_1 - C_4$ アルキルであり、 R_{135} は水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルまたは $C_1 - C_4$ アルコキシであり、 R_{136} は水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルまたは $C_1 - C_4$ アルコキシであるが、但し、 R_{135} および R_{136} は同時に水素でないことを条件とする]

40

の化合物に相当するか；

あるいは、下記式 XXVI：

【化 3 5】

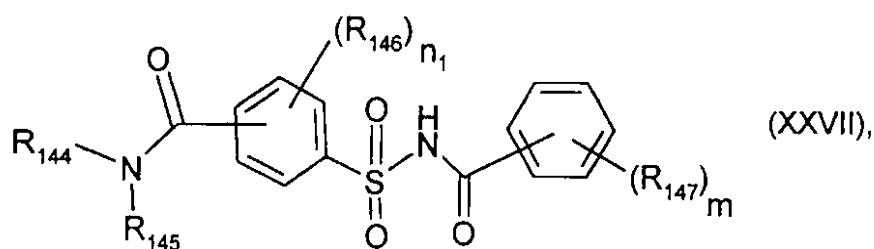


10

[式中、 R_{143} は水素、アルカリ金属陽イオン、アルカリ土類金属陽イオン、スルホニウム陽イオンまたはアンモニウム陽イオンであるか、またはエチルである]
 の化合物に相当するか；

あるいは、下記式 XXVII：

【化 3 6】



20

[式中、 R_{144} および R_{145} は各々他とは独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニルまたは $C_3 - C_6$ シクロアルキルであり、

R_{146} は水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルまたは $C_1 - C_6$ ハロアルコキシであり；

R_{147} は水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニルまたはニトロであり；

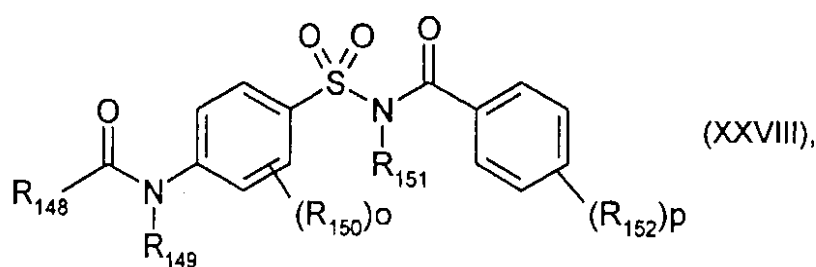
n_1 は 0、1、2 または 3 であり；そして

m は 1 または 2 である]

の化合物に相当するか；

あるいは、下記式 XXVIII：

【化 3 7】



40

50

[式中、

R_{148} は水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、フェニル、フェニル - $C_1 - C_6$ アルキルまたはヘテロアリールであり；上記基はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボニル、カルボキシル、ホルミル、カルボキサミドにより又はスルホンアミドにより置換されてよく；

R_{149} は水素、 $C_1 - C_6$ アルキルまたは $C_1 - C_4$ ハロアルキルであり；

各 R_{150} は他のいずれれとも独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、シアノ、ニトロ、ホルミルまたはカルボキシルであり；

R_{151} は水素、 $C_1 - C_6$ アルキルまたは $C_1 - C_4$ ハロアルキルであり；

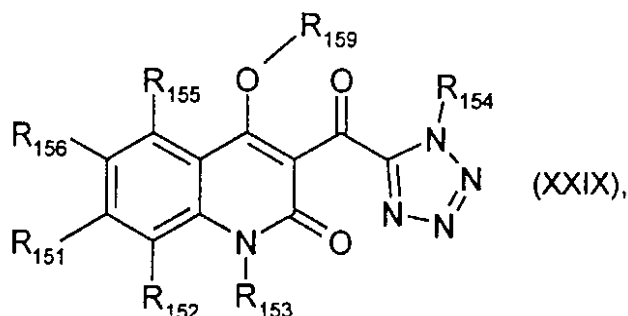
各 R_{152} は他のいずれれとも独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル、シアノ、ニトロ、ホルミルまたはカルボキシルであり；

o は 0、1 または 2 であり、そして、

p は 0、1 または 2 である]

の化合物に相当するか；あるいは、下記式 XXIX：

【化 38】



10

20

30

[式中、

R_{159} は水素、ホルミル、 C_{1-6} アルキルカルボニル、 C_{1-6} アルケニルカルボニル、 C_{1-6} アルキニルカルボニル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} アルキルチオカルボニル、 C_{3-8} シクロアルキルカルボニル、フェニル - C_{1-6} アルキニルカルボニル、フェニルカルボニル、 C_{1-6} アルキルスルホニル、 C_{1-6} アルケニルスルホニルまたはフェニルスルホニルであり、上記ヒドロカルビル基は 1 個以上のハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アミノ、メトキシ、エトキシまたはフェニル基により置換されてよく；

R_{153} は水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルケニル、 C_{1-6} アルキニル、 C_{3-8} シクロアルキル、ホルミル、 C_{1-6} アルキルカルボニル、 C_{1-6} アルケニルカルボニル、 C_{1-6} アルキニルカルボニル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} アルキルチオカルボニル、 C_{3-8} シクロアルキルカルボニル、 C_{1-6} アルキルスルホニル、 C_{1-6} アルケニルスルホニルまたはフェニルスルホニルであり、上記ヒドロカルビル基は 1 個以上のハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アミノ、メトキシ、エトキシまたはフェニル基により置換されてよく；

R_{154} は水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルケニル、 C_{1-6} アルキニル、 C_{3-8} シクロアルキル、ホルミル、 C_{1-6} アルキルカルボニル、 C_{1-6} アルケニルカルボニル、 C_{1-6} アルキニルカルボニル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} アルキルチオカルボニル、 C_{3-8} シクロアルキルカルボニル、 C_{1-6} アルキルスルホニル、 C_{1-6} アルケニルスルホニルまたはフェニルスルホニルであり、上記ヒドロカルビル基は 1 個以上のハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アミノ、メトキシ、エトキシまたはフェニル基により置換されてよく

40

50

;

R_{155} 、 R_{156} 、 R_{157} および R_{158} は各々他とは独立して、水素、ハロゲン、アミノ、 C_{1-3} アルキルアミノ、 C_{1-6} ジアルキルアミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、ホルミル、カルボキシル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルカルボニル、 C_{1-6} アルコシカルボニル、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルケニルまたは C_{1-6} アルキニルであり；

あるいは、 R_{153} および R_{158} はそれらが結合する環原子と一緒にあって、酸素、硫黄および窒素の群より選択される 2 個までの同じか又は異なるヘテロ原子を含有してよい一部飽和された又は不飽和の 5 または 6 員環を形成し、当該環はオキシ基により置換されてよい]

10

の化合物に相当する。

【0053】

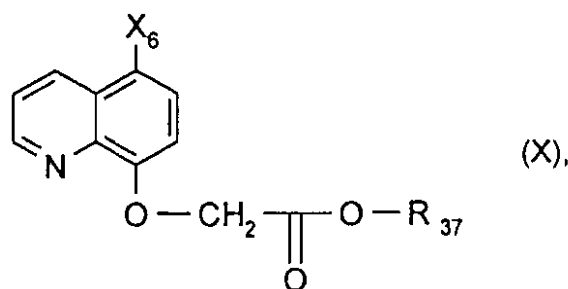
本発明に従う組成物は、好ましくは、除草剤拮抗作用のために有効な量の式 X、X I、X I I、X I I I、X I V、X V、X V I、X V I I、X V I I I、X I X、X X、X X I、X X I I、X X I I I、X X I V または X X V の毒性緩和剤を含む。

【0054】

本発明に従う選択的除草剤組成物は特に、除草剤拮抗作用のために有効な量の、下記式 X：

【化39】

20



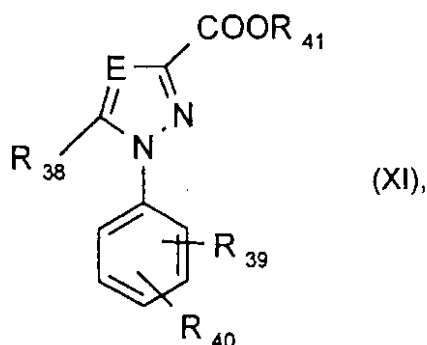
30

[式中、 R_{37} は水素、 $C_1 - C_8$ アルキル、あるいは $C_1 - C_8$ アルコキシにより又は $C_3 - C_6$ アルケニルオキシにより置換された $C_1 - C_8$ アルキルであり；そして X_6 は水素または塩素である]

の化合物；または下記式 X I：

【化40】

40



[式中、

50

E は窒素またはメチンであり；

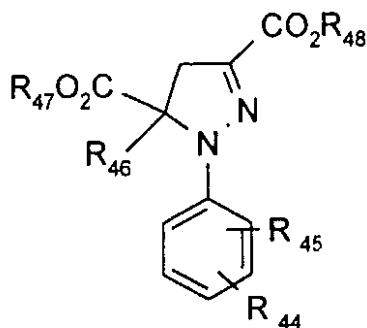
R_{38} は $-CCl_3$ 、フェニル、またはハロゲンにより置換されたフェニルであり；

R_{39} および R_{40} は各々他とは独立して、水素またはハロゲンであり；そして

R_{41} は $C_1 - C_4$ アルキルである]

の化合物；または下記式 X I I：

【化 4 1】



(XII),

10

[式中、 R_{44} および R_{45} は各々他とは独立して、水素またはハロゲンであり；そして

20

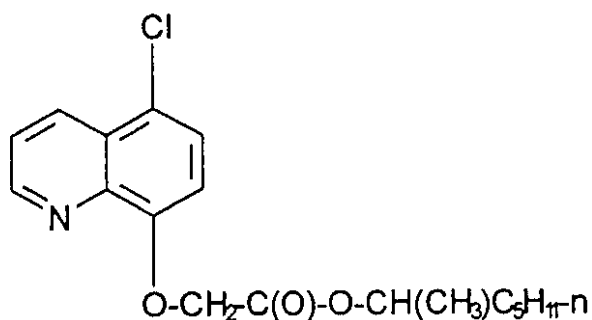
R_{46} 、 R_{47} および R_{48} は各々他とは独立して、 $C_1 - C_4$ アルキルである]

の化合物を含んでなる。

【 0 0 5 5 】

式 I の化合物について上記した好ましい意味は、式 I の化合物と式 X ~ X V I I I の毒性緩和剤との混合物の場合にも当てはまる。本発明に従う好ましい化合物は、下記式 X a：

【化 4 2】



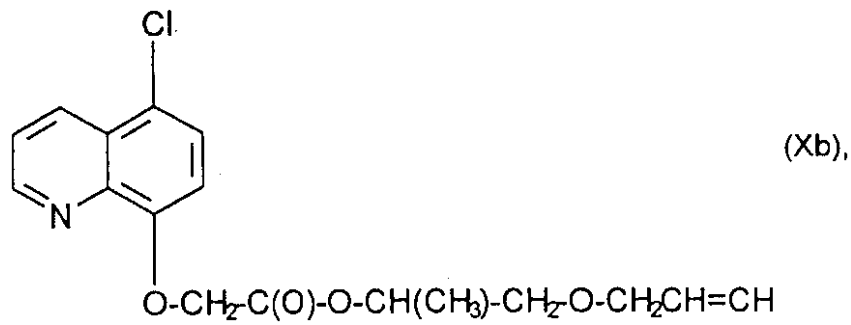
(Xa),

30

下記式 X b：

40

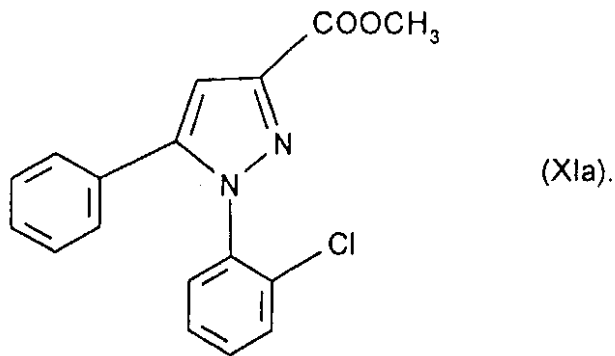
【化 4 3】



10

および下記式 X I a :

【化 4 4】



20

30

の群より選択される毒性緩和剤を含んでなる。

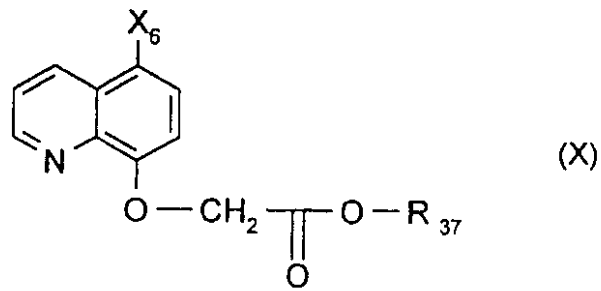
【 0 0 5 6 】

式 X、X I および X I I の更に好ましい化合物は、表 9、表 1 0 および表 1 1 にも列挙される。

【 0 0 5 7 】

【表 1】

表 9 : 式 X の化合物 :



10

化合物 no.	X ₆	R ₃₇
9.01	Cl	-CH(CH ₃)-C ₅ H _{11-n}
9.02	Cl	-CH(CH ₃)-CH ₂ OCH ₂ CH=CH ₂
9.03	Cl	H
9.04	Cl	C ₄ H _{9-n}

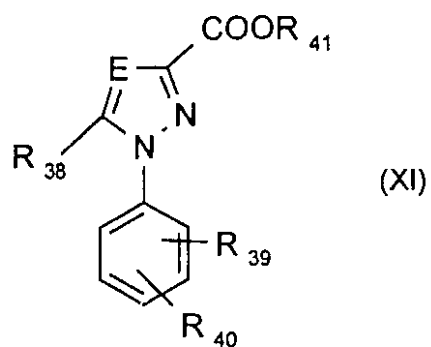
20

【 0 0 5 8 】

式 X I の好ましい化合物は、下記の表 1 0 に列挙される。

【表 2】

表10：式XIの化合物：



10

化合物 no.	R ₄₁	R ₃₈	R ₃₉	R ₄₀	E
10.01	CH ₃	フェニル	2-Cl	H	CH
10.02	CH ₃	フェニル	2-Cl	4-Cl	CH
10.03	CH ₃	フェニル	2-F	H	CH
10.04	CH ₃	2-クロロフェニル	2-F	H	CH
10.05	C ₂ H ₅	CCl ₃	2-Cl	4-Cl	N
10.06	CH ₃	フェニル	2-Cl	4-CF ₃	N
10.07	CH ₃	フェニル	2-Cl	4-CF ₃	N

20

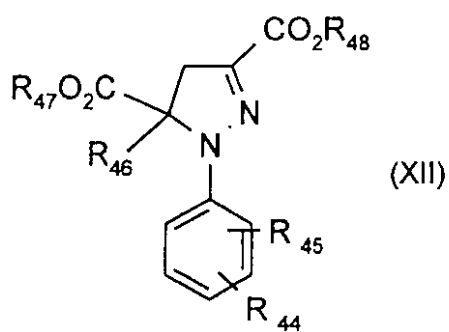
【0059】

式XIIの好ましい化合物は、下記の表11に列挙される。

30

【表 3】

表11：式XIIの化合物：



10

化合物 no.	R ₄₆	R ₄₇	R ₄₈	R ₄₄	R ₄₅
11.01	CH ₃	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl
11.02	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	2-Cl	4-Cl
11.03	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	2-Cl	4-Cl

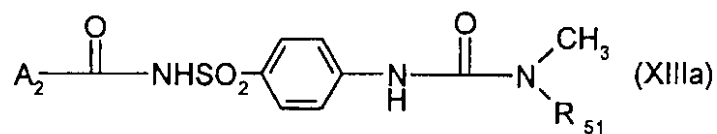
20

【0060】

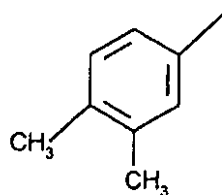
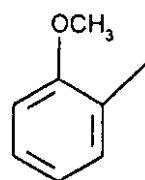
式XIIの好ましい化合物は、式XIIaの化合物として下記の表12に列挙される。

【表 4】

表12：式XIIIaの化合物

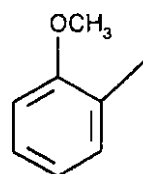
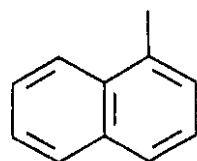


化合物 no.	A ₂	R ₅₁	
12.001		H	10
12.002		H	20
12.003		CH ₃	30
12.004		CH ₃	40



【表 5】

(表12のつづき)

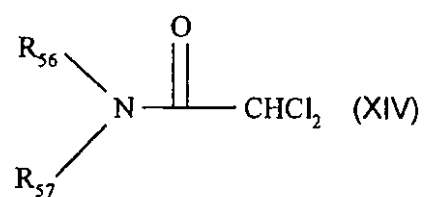


【0061】

式XIVの好ましい化合物は、下記の表13に列挙される。

【表 6】

表13: 式XIVの化合物:



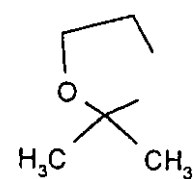
10

化合物 no.	R ₅₆	R ₅₇	R ₅₆ +R ₅₇
13.001	CH ₂ =CHCH ₂	CH ₂ =CHCH ₂	-

13.002

--

--

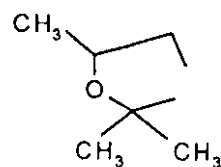


20

13.003

--

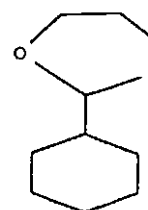
--



13.004

-

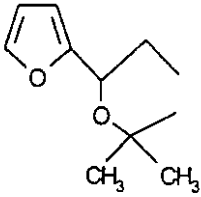
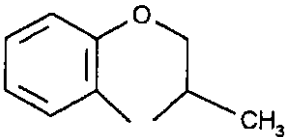
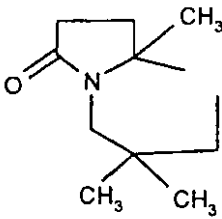
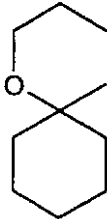
-



30

【表 7】

(表13のつづき)

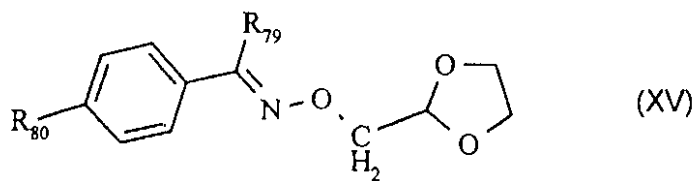
13.005	--	--		10
13.006	--	--		
13.007	--	--		20
13.008	--	--		30

【0062】

式XVの好ましい化合物は、下記の表14に列挙される。

【表 8】

表14：式XVの化合物：



化合物 no.	R ₈₀	R ₇₉
14.01	H	CN
14.02	Cl	CF ₃

10

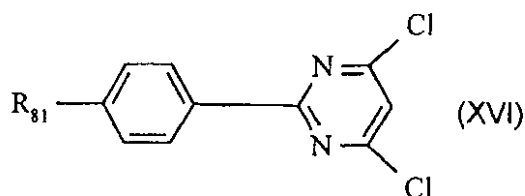
【0063】

式XVIの好ましい化合物は、下記の表15に列挙される。

20

【表 9】

表15：式XVIの化合物：



化合物 no.	R ₈₁
15.01	H
15.02	CH ₃

30

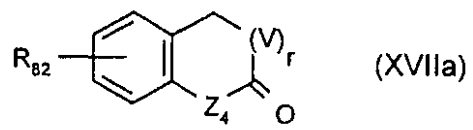
40

【0064】

式XVIIの好ましい化合物は、式XVIIaの化合物として下記の表16に列挙される。

【表 1 0】

表16：式XVIIaの化合物



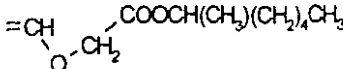
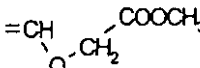
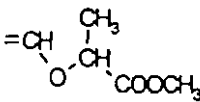
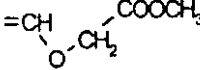
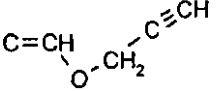
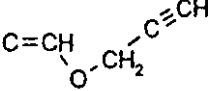
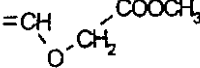
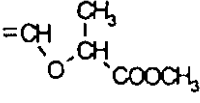
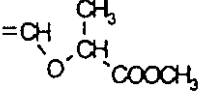
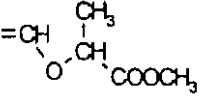
化合物 no.	R ₈₂	Z ₄	V	r
16.001	H		O	1
16.002	H		O	1
16.003	H		O	1

10

20

【表 1 1】

(表16のつづき)

化合物 no.	R ₈₂	Z ₄	V	r
16.004	H		O	1
16.005	H		CH ₂	1
16.006	H		CH ₂	1
16.007	H		S	1
16.008	H		S	1
16.009	H		NCH ₃	1
16.010	H		NCH ₃	1
16.011	H		NCH ₃	1
16.012	H		O	1
16.013	H		S	1

10

20

30

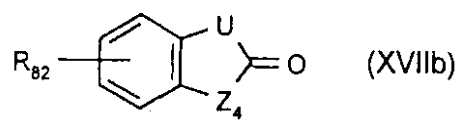
【0065】

40

式XVIIの好ましい化合物は、式XVIIbの化合物として下記の表17に列挙される。

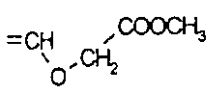
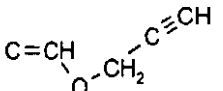
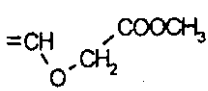
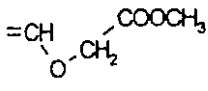
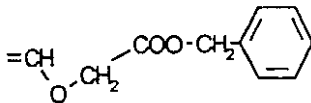
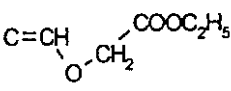
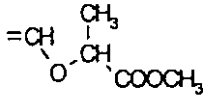
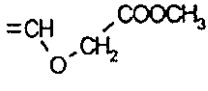
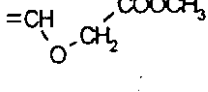
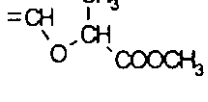
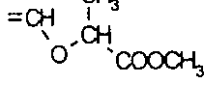
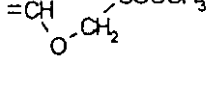
【表 1 2】

表17：式XVIIbの化合物



【表 1 3】

(表17のつづき)

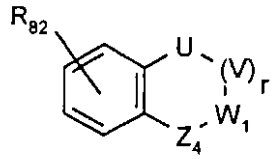
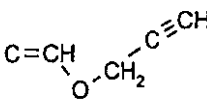
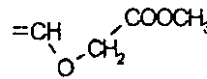
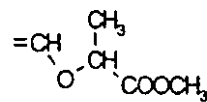
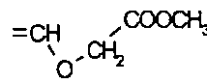
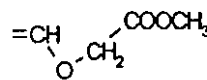
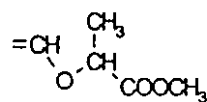
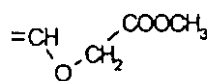
化合物 no.	U	R ₈₂	Z ₄	
17.001	O	H		
17.002	O	H		10
17.003	O	5-Cl		
17.004	CH ₂	H		
17.005	CH ₂	H		20
17.006	CH ₂	H		
17.007	NH	5-Cl		
17.008	NH	5-Cl		
17.009	NH	H		30
17.010	NH	H		
17.011	NCH ₃	H		
17.012	NCH ₃	H		40

【 0 0 6 6 】

式 X V I I の好ましい化合物は、式 X V I I c の化合物として下記の表 1 8 に列挙される。

【表 1 4】

表18：式XVIIcの化合物

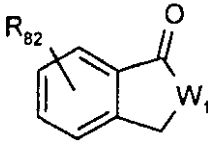
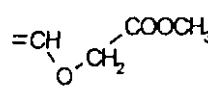
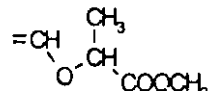
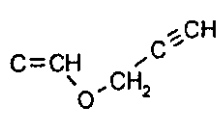
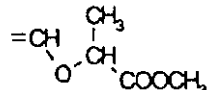
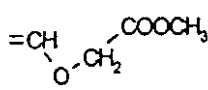
<div style="text-align: center;">  (XVIIc) </div>						
化合物 no.	U	V	r	W ₁	Z ₄	R ₈₂
18.001	O	C=O	1		CH ₂	H
18.002	O	C=O	1		CH ₂	H
18.003	CH ₂	C=O	1		CH ₂	H
18.004	CH ₂	C=O	1		CH ₂	H
18.005	CH ₂	CH ₂	1		C=O	H
18.006	CH ₂	CH ₂	1		C=O	H
18.007	NCH ₃	C=O	1		CH ₂	H

【 0 0 6 7 】

式XVIIcの好ましい化合物は、式XVIIcの化合物として下記の表19に列挙される。

【表 15】

表19：式XVIIIdの化合物

			(XVIIId)
化合物 no.	R ₈₂	W ₁	
19.001	6-Cl		10
19.002	6-Cl		
19.003	H		
19.004	H		20
19.005	H		

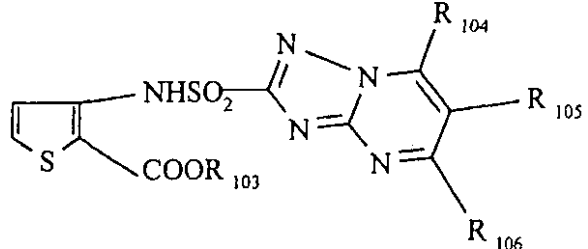
【0068】

式XVIIIIの好ましい化合物は、下記の表20に列挙される。

30

【表 16】

表20：式XVIIIIの化合物

					(XVIII),
化合物 no.	R ₁₀₃	R ₁₀₄	R ₁₀₅	R ₁₀₆	
20.01	CH ₃	H	シクロピリル	H	
20.02	CH ₃	C ₂ H ₅	シクロピリル	H	
20.03	CH ₃	シクロピリル	C ₂ H ₅	H	

40

50

【表 17】

(表20のつづき)

20.04	CH ₃	CH ₃	H	H	
20.05	CH ₃	CH ₃	cyclopropyl	H	
20.06	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H	
20.07	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H	
20.08	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	10
20.09	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	
20.10	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H	
20.11	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	H	
20.12	H	OCH ₃	OCH ₃	H	
20.13	H	CH ₃	CH ₃	H	
20.14	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	
20.15	H	H	H	CH ₃	
20.16	CH ₃	H	H	CH ₃	20
20.17	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	

【0069】

式XVIIの化合物のうち好ましいのは、式中、R₁₄₈が水素、C₁-C₆アルキル、C₃-C₈シクロアルキルまたはフェニルであり、上記基はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボニル、カルボキシル、ホルミル、カルボキサミドにより又はスルホンアミドにより置換されてよく；

R₁₄₉が水素であり；

各R₁₅₀が他のいずれれとも独立して、水素、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、C₁-C₄アルキルチオ、シアノ、ニトロまたはホルミルであり；

R₁₅₁が水素であり；そして

各R₁₅₂が他のいずれれとも独立して、水素、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、C₁-C₄アルキルチオ、シアノ、ニトロまたはホルミルである、化合物である。

【0070】

式XVIIの特に好ましい化合物は、以下の群、

2-メトキシ-N-[4-(2-メトキシベンゾイルスルファモイル)フェニル]アセトアミド、

N-[4-(2-メトキシベンゾイルスルファモイル)フェニル]シクロプロパンカルボキサミド、

N-[4-(2-メトキシベンゾイルスルファモイル)フェニル]シクロブタンカルボキサミド、

N-[4-(2-クロロベンゾイルスルファモイル)フェニル]シクロプロパンカルボキサミド、

N-[4-(2-クロロベンゾイルスルファモイル)フェニル]アセトアミド、

N-[4-(2-トリフルオロメトキシベンゾイルスルファモイル)フェニル]アセトアミド、

N - [4 - (2 - トリフルオロメチルベンゾイルスルファモイル) フェニル] シクロプロパンカルボキサミド、

N - [4 - (2 - トリフルオロメトキシベンゾイルスルファモイル) フェニル] シクロプロパンカルボキサミド、

N - [4 - (2 - トリフルオロメトキシベンゾイルスルファモイル) フェニル] シクロブタンカルボキサミド、および

N - [4 - (2 - トリフルオロメチルベンゾイルスルファモイル) フェニル] アセトアミドより選択される。

【 0 0 7 1 】

式 X X I X の化合物のうち好ましいのは、式中、 R_{159} が水素、ホルミル、 C_{1-6} アルキルカルボニル、 C_{1-6} アルケニルカルボニル、 C_{1-6} アルキニルカルボニル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} アルキルチオカルボニル、 C_{3-8} シクロアルキルカルボニル、フェニル - C_{1-6} アルキニルカルボニルまたはフェニルカルボニルであり、上記ヒドロカルビル基は 1 個以上のハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アミノ、メトキシ、エトキシまたはフェニル基により置換されてよく；

R_{153} が水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルケニル、 C_{1-6} アルキニル、ホルミル、 C_{1-6} アルキルカルボニルまたは C_{1-6} アルコキシカルボニルであり、上記ヒドロカルビル基は 1 個以上のハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アミノ、メトキシ、エトキシまたはフェニル基により置換されてよく；

R_{154} が水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルケニル、 C_{1-6} アルキニル、ホルミル、 C_{1-6} アルキルカルボニルまたは C_{1-6} アルコキシカルボニルであり、上記ヒドロカルビル基は 1 個以上のハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アミノ、メトキシ、エトキシまたはフェニル基により置換されてよく；

R_{155} 、 R_{156} 、 R_{157} および R_{158} が各々他とは独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ホルミル、カルボキシル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルカルボニル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルであり；

あるいは、 R_{153} および R_{158} はそれらが結合する環原子と一緒にあって、酸素、硫黄および窒素の群より選択される 2 個までの同じか又は異なるヘテロ原子を含有してよい一部飽和された又は不飽和の 5 または 6 員環を形成し、当該環はオキソ基により置換されてよい、

化合物である。

【 0 0 7 2 】

特に好ましい式 X X I X の化合物は、式中、

R_{159} が水素、ホルミル、 C_{1-6} アルキルカルボニル、 C_{1-6} アルケニルカルボニル、 C_{1-6} アルキニルカルボニル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} アルキルチオカルボニル、 C_{3-8} シクロアルキルカルボニルまたはフェニルカルボニルであり；

R_{153} が水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルケニル、 C_{1-6} アルキニル、ホルミル、 C_{1-6} アルキルカルボニルまたは C_{1-6} アルコキシカルボニルであり；

R_{154} が水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルケニル、 C_{1-6} アルキニル、ホルミル、 C_{1-6} アルキルカルボニルまたは C_{1-6} アルコキシカルボニルであり；

R_{155} 、 R_{156} 、 R_{157} および R_{158} が各々他とは独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ホルミル、 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシまたは C_{1-6} ハロアルコキシであり；

あるいは、 R_{153} および R_{158} はそれらが結合する環原子と一緒にあって、酸素、硫黄および窒素の群より選択される 2 個までの同じか又は異なるヘテロ原子を含有してよい一部飽和された又は不飽和の 5 または 6 員環を形成し、当該環はオキソ基により置換されてよい、

化合物である。

【 0 0 7 3 】

式 X X I X の特に好ましい化合物は、以下の群：

- 4 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 3 - (1 H - テトラゾール - 5 - カルボニル) - 1 H - キノリン - 2 - オン、
 1 - エチル - 4 - ヒドロキシ - 3 - (1 H - テトラゾール - 5 - カルボニル) - 1 H - キノリン - 2 - オン、
 6 - ヒドロキシ - 5 - (1 H - テトラゾール - 5 - カルボニル) - 1 , 2 - ジヒドロ - ピロロ [3 , 2 , 1 - . i j .] キノリン - 4 - オン
 3 - (1 - アセチル - 1 H - テトラゾール - 5 - カルボニル) - 4 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 1 H - キノリン - 2 - オン、
 6 - クロロ - 4 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 3 - (1 H - テトラゾール - 5 - カルボニル) - 1 H - キノリン - 2 - オン、
 6 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 3 - (1 H - テトラゾール - 5 - カルボニル) - 1 H - キノリン - 2 - オン、
 4 - ヒドロキシ - 1 , 6 - ジメチル - 3 - (1 H - テトラゾール - 5 - カルボニル) - 1 H - キノリン - 2 - オン、
 4 - ヒドロキシ - 6 - メトキシ - 1 - メチル - 3 - (1 H - テトラゾール - 5 - カルボニル) - 1 H - キノリン - 2 - オン、
 4 - ヒドロキシ - 6 - メトキシ - 1 - メチル - 3 - (1 H - テトラゾール - 5 - カルボニル) - 1 H - キノリン - 2 - オン、
 酢酸 1 - メチル - 2 - オキソ - 3 - (1 H - テトラゾール - 5 - カルボニル) - 1 , 2 - ジヒドロ - キノリン - 4 - イルエステル、および
 2 , 2 - ジメチルプロピオン酸 1 - メチル - 2 - オキソ - 3 - (1 H - テトラゾール - 5 - カルボニル) - 1 , 2 - ジヒドロ - キノリン - 4 - イルエステルより選択される。

【 0 0 7 4 】

本発明は、有用植物の栽培において雑草を選択的に抑制する方法にも関し、この方法は除草剤として有効な量の式 I の除草剤、および除草剤拮抗作用のために有効な量の式 X、X I、X I I、X I I I、X I V、X V、X V I、X V I I、X V I I I、X I X、X X、X X I、X X I I、X X I I I、X X I V、X X V、X X V I、X X V I I、X X V I I I または X X I X、好ましくは式 X、X I、X I I、X I I I、X I V、X V、X V I、X V I I または X V I I I の毒性緩和剤により同時に又は別個に、有用植物、種子、それらの挿木、またはそれらの栽培領域を処理することを含んでなる。

【 0 0 7 5 】

抑制されるべき雑草は、単子葉草でも双子葉草でもよく、例えば、単子葉草であるアベナ属 (Avena)、コヌカグサ属 (Agrostis)、クサヨシ属 (Phalaris)、ロリウム属 (Lolium)、ブrooms 属 (Bromus)、スズメノテッポウ属 (Alopecurus)、エイコログサ属 (Setaria)、メヒシバ属 (Digitaria)、ブラキアリア属 (Brachiaria)、ヒエ属 (Echinochloa)、キビ属 (Panicum)、モロコシ属 (Sorghum hal./bic.)、ツノアイアシ属 (Rottboellia)、シベラス属 (Cyperus)、ブラキアリア属 (Brachiaria)、ヒエ属 (Echinochloa)、シルプス属 (Scirpus)、ミズアオイ属 (Monochoria)、サギタリア属 (Sagittaria) およびハコベ属 (Stellaria)、ならびに双子葉草であるシナピス属 (Sinapis)、アカザ属 (Chenopodium)、ヤエムグラ属 (Galium)、スミレ属 (Viola) およびペロニカ属 (Veronica)、マトリカリア属 (Matricaria)、ケシ属 (Papaver)、ナス属 (Solanum)、アブティロン属 (Abutilon)、シダ属 (Sida)、オナモミ属 (Xanthium)、アマランツス属 (Amaranthus)、イボメア属 (Ipomoea) およびクリサンセマム属 (Chrysanthemum)、等が挙げられる。

【 0 0 7 6 】

栽培領域とは、栽培植物が既に生長しつつあるか又はこれらの栽培植物の種子がまかされている土地、ならびにこのような栽培植物の栽培が意図される土地を含む。

【 0 0 7 7 】

意図される用途によって、式 X、X I、X I I、X I I I、X I V、X V、X V I、X V I I、X V I I I、X I X、X X、X X I、X X I I、X X I I I、X X I V、X X V

、X X V I、X X V I I、X X V I I IまたはX X I Xの毒性緩和剤を栽培植物の種子の前処理（種子または挿木のドレッシング）に使用することができ、あるいはこれを種蒔きの前または後に土壤に導入することができる。しかしながら、植物の出芽後に、これを単独で又は除草剤と一緒に適用することもできる。したがって、毒性緩和剤による植物または種子の処理は、原則として、除草剤が適用される時点とは無関係に行うことができる。しかしながら、植物を除草剤と毒性緩和剤の同時適用により（例えばタンク混合物の形態で）処理することもできる。毒性緩和剤の適用レートと除草剤の適用レートの比は、適用方法に大きく依存する。毒性緩和剤と除草剤の組合せを含んでなるタンク混合物を使用するか又は毒性緩和剤と除草剤の別個に使用して行われる土壌処理（field treatment）の場合には、除草剤と毒性緩和剤の比は、一般に100：1～1：10、好ましくは20：1～1：1である。土壌処理の場合には、0.001～1.0kgの毒性緩和剤/ha、好ましくは0.001～0.25kgの毒性緩和剤/haを適用するのが通常である。

10

【0078】

除草剤の適用レートは、一般には0.001～2kg/haであるが、好ましくは0.005～0.5kg/haである。

【0079】

本発明に従う組成物は、農業に通常使用されている全ての適用方法、例えば、出芽前適用、出芽後適用および種子ドレッシング、に適している。

【0080】

種子ドレッシングの場合には、一般に0.001～10g毒性緩和剤/kg種子、好ましくは0.05～2g毒性緩和剤/kg種子が適用される。毒性緩和剤が、種子の浸漬により、種蒔き前に短時間、液状形態で適用される場合には、使用される毒性緩和剤溶液が活性成分を1～10000ppm、好ましくは100～1000ppmの濃度で有利に含有する。

20

【0081】

適用目的のために、式X、X I、X I I、X I I I、X I V、X V、X V I、X V I I、X V I I I、X I X、X X、X X I、X X I I、X X I I I、X X I V、X X V、X X V I、X X V I I、X X V I I IまたはX X I Xの毒性緩和剤あるいはこれら毒性緩和剤と式Iの除草剤との組合せを、配合技術において通例である助剤と一緒に、例えば、乳化可能な濃縮物、コーティング可能なペースト、直接スプレー可能な又は希釈可能な溶液、希釈エマルジョン、湿潤可能な粉、微粉、顆粒またはマイクロカプセルの形に有利に配合することができる。

30

【0082】

このような配合物は、例えば、国際公開公報WO97/34485号、第9頁～13頁に記載されている。配合物は、活性成分を液状または固形の配合助剤、例えば、溶媒または固形担体と十分に混合し及び/又は粉碎することにより、既知の方法で調製される。これに加えて、界面活性化合物（界面活性剤）も配合物の調製において使用できる。その目的に適した溶媒および固形担体は、例えば、国際公開公報WO97/34485号の第6頁に記載されている。

【0083】

配合されるべき式Iの化合物の性質により、界面活性化合物として、良好な乳化性、分散性および湿潤性をもった非イオン性、陽イオン性および/または陰イオン性界面活性剤が考慮される。適した陰イオン性、非イオン性および陽イオン性界面活性剤の例は、例えば、国際公開公報WO97/34485号の第7頁および8頁に記載されている。また、本発明に従う除草剤組成物の調製に適しているのは、とりわけ"McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual" MC Publishing Corp., Ridgewood, New Jersey, 1981, Stach e, H., "Tensid-Taschenbuch", Carl Hanser Verlag, Munich/Vienna 1981, およびM. and J. Ash, "Encyclopedia of Surfactants", Vol. I-III, Chemical Publishing Co., New York, 1980-81に記載されている、配合技術で通常使用されている界面活性剤である。

40

【0084】

50

除草剤配合物は、通常、0.1～99重量%、特に0.1～95重量%の、式Ⅰの化合物および式X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIII、XXIXまたはXXXの化合物を含んでなる活性成分混合物と、1～99.9重量%の固形または液状の配合助剤と、0～25重量%、特に0.1～25重量%の界面活性剤とを含有する。商業製品は濃縮物として通常配合されるのに対し、最終使用者は希釈配合物を通常使用するだろう。

【0085】

組成物は、安定剤、例えば植物オイルまたはエポキシド化植物オイル（エポキシド化ココナッツ油、ナタネ油または大豆油）、消泡剤、例えばシリコンオイル、保存剤、粘度調整剤、結合剤、粘着付与剤、さらには肥料または他の活性成分などのような更なる成分を含んでもよい。式Ⅰの除草剤の有害効果からの栽培植物の保護における式X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIIIまたはXXXの毒性緩和剤の使用またはそれらを含む組成物の使用のために、様々な方法および技術、例えば以下のものが考慮される。

【0086】

i) 種子ドレッシング

a) 容器内で振盪することにより種子表面上に均一に分布するまで式X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIIIまたはXXXの化合物の湿潤可能粉配合物で種子をドレッシングする（乾式ドレッシング）。当該方法では、種子100kg当たり約1～500gの式X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVIIまたはXXXの化合物（4g～2kgの湿潤可能粉）が使用される。

b) 方法a)に従う式X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVIIまたはXXXの化合物の乳化可能濃縮物で種子をドレッシングする（湿式ドレッシング）。

c) 100～1000ppmの式X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVIIまたはXXXの化合物を含む液の中で種子を1～24時間浸漬することによりドレッシングする（浸漬ドレッシング）。

【0087】

種子のドレッシングまたは発芽種子の処理は、活性成分での処理が完全に目的作物に向けられるので、当然に好ましい適用方法である。一般に、種子100kg当たり1～1000g、好ましくは5～250gの解毒剤が使用されるが、他の活性成分または微量栄養素が添加されることも可能にする方法によっては、示された限度を上回るか又は下回る濃度も使用し得る（反復ドレッシング）。

【0088】

i i) タンク混合物としての適用

解毒剤と除草剤との混合物の液状配合物が使用され（一方の他方に対する重量比は10:1～1:100）、除草剤の適用レートは0.005～5.0kg/ヘクタールである。このようなタンク混合物は種蒔きの前または後に適用される。

【0089】

i i i) 種子溝に対する適用

式X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIIIまたはXXXの化合物は、乳化可能濃縮物、湿潤可能粉または顆粒の形態

10

20

30

40

50

で、むき出しの播種後の種子の溝 (furrow) に導入される。種子溝が被覆されると、除草剤が通常の方法により出芽前適用される。

【0090】

i v) 活性成分の制御された放出

式 X、X I、X I I、X I I I、X I V、X V、X V I、X V I I、X V I I I、X I X、X X、X X I、X X I I、X X I I I、X X I V、X X V、X X V I、X X V I I、X X V I I I または X X I X の化合物は、鉍質担体顆粒または重合化顆粒 (尿素 / ホルムアルデヒド) に溶液で適用され、乾燥される。望ましければ、活性成分が特定の期間にわたって一定量放出されることを可能にするコーティングを適用することも可能である (被覆顆粒)。

10

【0091】

除草剤として有効な量の式 I の除草剤、および除草剤拮抗作用のために有効な量の式 X、X I、X I I、X I I I、X I V、X V、X V I、X V I I、X V I I I、X I X、X X、X X I、X X I I、X X I I I、X X I V、X X V、X X V I、X X V I I、X X V I I I または X X I X の毒性緩和剤を含有する、本発明に従う除草および植物生長阻害組成物の活性は、上述したように、スプレータンク助剤を添加することにより増大させることができる。

【0092】

好ましい配合物は、特に以下の組成を有する：

(% = 重量 %)

20

【表 18】

乳化可能濃縮物：

活性成分混合物： 1～90 %，好ましくは 5～20 %

界面活性剤： 1～30 %，好ましくは 10～20 %

液状担体： 5～94 %，好ましくは 70～85 %

10

微粉：

活性成分混合物： 0.1～10 %，好ましくは 0.1～ 5 %

固形担体： 99.9～90 %，好ましくは 99.9～99 %

懸濁濃縮物：

活性成分混合物： 5～75 %，好ましくは 10～50 %

水： 94～24 %，好ましくは 88～30 %

界面活性剤： 1～40 %，好ましくは 2～30 %

20

湿潤可能粉：

活性成分混合物： 0.5～90 %，好ましくは 1～80 %

界面活性剤： 0.5～20 %，好ましくは 1～15 %

固形担体： 5～95 %，好ましくは 15～90 %

30

顆粒：

活性成分混合物： 0.1～30 %，好ましくは 0.1～15 %

固形担体： 99.5～70 %，好ましくは 97～85 %

【0093】

以下の例は本発明を更に例示するものであるが、本発明を限定するものではない。

【実施例】

【0094】

40

式 I の除草剤と式 X、X I、X I I、X I I I、X I V、X V、X V I、X V I I、X V I I I、X I X、X X、X X I、X X I I、X X I I I、X X I V、X X V、X X V I、X X V I I、X X V I I I または X X I X の毒性緩和剤との混合物についての配合例（% = 重量 %）

【表 19】

<u>F 1. 乳化可能濃縮物</u>	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	5 %	10 %	25 %	50 %
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	6 %	8 %	6 %	8 %
ヒマシ油ポリグリコールエーテル (36モルのエチレンオキシド)	4 %	—	4 %	4 %
オクチルフェノールポリグリコールエーテル (7～8モルのエチレンオキシド)	—	4 %	—	2 %
シクロヘキサノン	—	—	10 %	20 %
芳香族炭化水素混合物 C ₉ —C ₁₂	85 %	78 %	55 %	16 %

10

このような濃縮物から、水で希釈することにより、いずれの所望される濃度のエマルジョンも得ることができる。

【0095】

【表 20】

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

30

溶液は微小滴の形態での使用に適している。

【0096】

40

【表 2 1】

<u>F 3. 湿潤可能粉</u>	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	5 %	25 %	50 %	80 %
リグノスルホン酸ナトリウム	4 %	-	3 %	-
ラウリル硫酸ナトリウム	2 %	3 %	-	4 %
ジイソブチルナフタレンスルホン酸ナトリウム	-	6 %	5 %	6 %
オクチルフェノールポリグリコールエーテル	-	1 %	2 %	-
(7～8モルのエチレンオキシド)				
高分散ケイ酸	1 %	3 %	5 %	10 %
カオリン	88 %	62 %	35 %	-

10

活性成分は助剤と十分に混合され、その混合物は適当なミルで十分に粉碎されて、いずれの所望濃度の懸濁液をも与えるために水により希釈できる湿潤可能粉を生じる。

【0097】

20

【表 2 2】

<u>F 4. 被覆顆粒</u>	a)	b)	c)
活性成分混合物	0.1 %	5 %	15 %
高分散ケイ酸	0.9 %	2 %	2 %
無機担体	99.0 %	93 %	83 %

(直径0.1～1mm)

30

例えばCaCO₃ またはSiO₂

活性成分は塩化メチレン中に溶解され、スプレーにより担体に適用され、そして次に、溶媒が減圧中でエバポレーションにより除去される。

【0098】

【表 2 3】

<u>F 5. 被覆顆粒</u>	a)	b)	c)
活性成分混合物	0.1 %	5 %	15 %
ポリエチレングリコール MW200	1.0 %	2 %	3 %
高分散ケイ酸	0.9 %	1 %	2 %
無機担体	98.0 %	92 %	80 %
(直径0.1 ~ 1 mm)			
例えばCaCO ₃ またはSiO ₂			

10

微粉碎された活性成分が、ポリエチレングリコールで湿潤化された担体に、ミキサー内で均一に適用される。このようにして微粉でない被覆顆粒が得られる。

【0099】

【表 2 4】

20

<u>F 6. 押出顆粒</u>	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	0.1 %	3 %	5 %	15 %
リグノスルホン酸ナトリウム	1.5 %	2 %	3 %	4 %
カルボキシメチルセルロース	1.4 %	2 %	2 %	2 %
カオリン	97.0 %	93 %	90 %	79 %

活性成分は助剤と混合および粉碎され、その混合物が水で湿潤化される。その混合物が押し出され、次に気流中で乾燥させられる。

30

【0100】

【表 2 5】

<u>F 7. 微粉</u>	a)	b)	c)
活性成分混合物	0.1 %	1 %	5 %
タルカム	39.9 %	49 %	35 %
カオリン	60.0 %	50 %	60 %

40

活性成分を担体と混合し、その混合物を適当なミルで粉碎することにより、直ぐに使用できる状態の微粉が得られる。

【0101】

【表 2 6】

F 8. 懸濁濃縮物	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	3 %	10 %	25 %	50 %
エチレングリコール	5 %	5 %	5 %	5 %
ノニルフェノールポリグリコールエーテル	-	1 %	2 %	-
(15モルのエチレンオキシド)				
リグノスルホン酸ナトリウム	3 %	3 %	4 %	5 %
カルボキシメチルセルロース	1 %	1 %	1 %	1 %
37%水性ホルムアルデヒド溶液	0.2 %	0.2 %	0.2 %	0.2 %
シリコーンオイルエマルジョン	0.8 %	0.8 %	0.8 %	0.8 %
水	87 %	79 %	62 %	38 %

10

微粉碎された活性成分が助剤と十分に混合されて、懸濁濃縮物を生じ、この濃縮物を水で希釈することにより、いずれの所望濃度の懸濁液をも得ることができる。

20

【0102】

式 I の化合物と式 X、X I、X I I、X I I I、X I V、X V、X V I、X V I I、X V I I I、X I X、X X、X X I、X X I I、X X I I I、X X I V、X X V、X X V I、X X V I I、X X V I I I または X X I X の混合相手とを、別個に配合し、次に、適用前の短時間、水中の「タンク混合物」の形態で、アプリケーター内で所望される混合比で一緒にすることが実用的である場合が多い。

【0103】

式 I の化合物は、既知の更なる複数の除草剤と共に有利に混合されることがあり、それにより雑草スペクトルの実質的な広範囲化がもたらされ、また多くの場合に、有用植物に対する選択性の増大がもたらされる。特に、式 I の化合物と下記の除草剤の少なくとも1種との混合物が重要である：

30

例えばジクロフォップ - メチル、フルアジフォップ - P - ブチル、キザラフォップ - P - エチル、プロパキザフォップ、クロジナフォップ - P - プロパルギル、シハロフォップ - ブチル、フェノキサ - P - エチル、ハロキシフォップ - メチルまたはハロキシフォップ - エトチル等のような、フェノキシ - フェノキシプロピオン酸のクラスからの除草剤；

例えばセトキシジム、アロキシジム、クレトジム、シクロキシジム、テプラロキシジム、トラルコキシジムまたはブトロキシジム等のような、ヒドロキシルアミンのクラスの除草剤；

例えばアミドスルフロン、アジムスルフロン、ベンスルフロン - メチル、クロリムロン - エチル、シノスルフロン、クロルスルフロン、クロリムロン、シクロスルファミロン、エタメトスルフロン - メチル、エトキシスルフロン、フルアザスルフロン、フルピルスルフロン、イマゾスルフロン、ヨードスルフロン (CAS RN 144550-36-7 および 185119-76-0)、メトスルフロン - メチル、ニコスルフロン、オキサスルフロン、プリミスルフロン、ピラゾスルフロン - エチル、スルホスルフロン、リムスルフロン、チフェンスルフロン - メチル、トリアスルフロン、トリベヌロン - メチル、トリフルスルフロン - メチル、プロスルフロン、フルカルバゾンまたはトリトスルフロン (CAS RN 142469-14-5) 等のような、スルホニル尿素のクラスの除草剤；

40

例えばイマゼサピル、イマザメタベンズ、イマザメタピル、イマザキン、イマザモックスまたはイマザピル等のような、イミダゾリノンのクラスの除草剤；

50

ピリチオバック - ナトリウム、ピリミノバック、ビスピリバック - ナトリウム等のような、ピリミジンのクラスの除草剤；

例えばアトラジン、シマジン、シメトリン、テルブトリン、テルブチラジン等のような、トリアジンのクラスの除草剤；

例えばイソプロツロン、クロロトルロン、ジウロン、ジムロン、フルオメツロン、リヌロンまたはメタベンズチアズロン等のような、尿素のクラスの除草剤；

例えばグリホサート、グルホシネート、スルホサートまたはホスフィノスリチン等のような、ホスホン酸のクラスの除草剤；

例えばニトロフェン、ピフェノックス、アシフロフェン、ラクトフェン、オキシフルオルフェン、エトキシフェン、フルオログリコフェン、フォメサフェン、ハロサフェン、アザフェニジン (CAS RN 68049-83-2)、ベンズフェンジゾン (CAS RN 158755-95-4)、ブタフェナシル (US-A-5183492より公知, CAS RN 158755-95-4)、カルフェントラゾン - エチル、シニドン - エチル (CAS RN 142891-20-1)、フルミクロラック - ペンチル、フルミオキサジン、フルチアセト - メチル、オキサジアルギル、オキサジアゾン、ペントキサゾン、スルフェントラゾン、フルアゾレート (CAS RN 174514-07-9) またはピラフルフェン - エチル等のような、PPO化合物のクラスからの除草剤；

例えばアラクロル、アセトクロル、ブタクロル、ジメタクロル、ジメテナミド、S - ジメテナミド、メトアザクロル、メトラクロル、S - メトラクロル、プレチラクロル、プロバクロル、プロピソクロル、テニルクロルまたはベトキサミド (CAS RN 106700-29-2) 等のような、クロロアセトアニリドのクラスからの除草剤；

例えば2, 4 - D, フルオロキシビル, MCPA, MCPP, MCPB, トリクロピルまたはメコプロブ - P 等のような、フェノキシ酢酸のクラスからの除草剤；

例えばヘキサジノン、メタミトロンまたはメトリブジン等のような、トリアジノンのクラスからの除草剤；

例えばオリザリン、ペンジメタリンまたはトリフルラリン等のような、ジニトロアニリンのクラスからの除草剤；

例えばクロリダゾンまたはノルフラゾン等のような、アジノンのクラスからの除草剤；

例えばクロルプロファム、デスメジファム、フェンメジファムまたはプロファム等のような、カルバメートのクラスからの除草剤；

例えばメフェナセトまたはフルチアセト等のような、オキシアセトアミドのクラスからの除草剤；

例えばブチレート、シクロエート、ジアレート、EPTC、エスプロカルブ、モリネート、プロスルホカルブ、チオベンカルブまたはトリアレート等のような、チオカルバメートのクラスからの除草剤；

例えばフェントラザミド (CAS RN 158237-07-1) またはカフェンストロール等のような、アゾロウレア (azoloureas) のクラスからの除草剤；

例えばジカムバまたはピクロラム等のような、安息香酸のクラスからの除草剤；

例えばジフルフェニカンまたはプロパニル等のような、アニリドのクラスからの除草剤；

例えばプロモキシニル、ジクロベニルまたはイオキシニル等のような、ニトリルのクラスからの除草剤；

例えばサルコトリオン、メソトリオン (US-A-5006158より公知)、イソキサフルトールまたはイソキサクロルトール等のような、トリオンのクラスからの除草剤；

例えばフルカルバゾン (CAS RN 181274-17-9)、プロカルバゾン (CAS RN 145026-81-9)、クロランスラム、ジクロスラム (CAS RN 145701-21-9)、フローラスラム、フルメトスラムまたはメトスラム等のような、スルホンアミドのクラスからの除草剤；

さらにまた、アミトロール、ベンフレセート、ベントゾン、シンメチリン、クロマゾン、クロピラリド、ジフェンゾクアト (difenzoquat)、ジチオピル、エトフメセート、フルオロクロリドン、インダノファン、イソキサベン、オキサジクロメホン、ピリデート、ピリダフォル (pyridafol, CAS RN 40020-01-7)、キンコラック、キンメラック、トリジフ

ァンまたはフラムプロブ、アミカルバゾン、ベンフルアミド、ベンゾピシクロン、フルフェナセト、フルフェンビル、ホラムスルフロソ、インダノファン、メソスルフロソ、オキサジクロメホン、ペノクスラム、ペトキサミド、ピコリナフェン、プロフルアゾール、プロホキシジム、プロボキシカルバゾン、ピラフルフェン、ピラゾギル、スルホスルフロソ、テブラロキシジムまたはトリトスルフロソ。

【0104】

特に示さない限り、式Iの化合物に対する上記の混合相手はThe Pesticide Manual, Eleventh Edition, 1997, BCPCより知られているものである。式Iの化合物に対する混合相手は、適当な場合には、例えばThe Pesticide Manual, Eleventh Edition, 1997, BCPCに言及されるようなエステルまたは塩の形態でも存在し得る。

10

【0105】

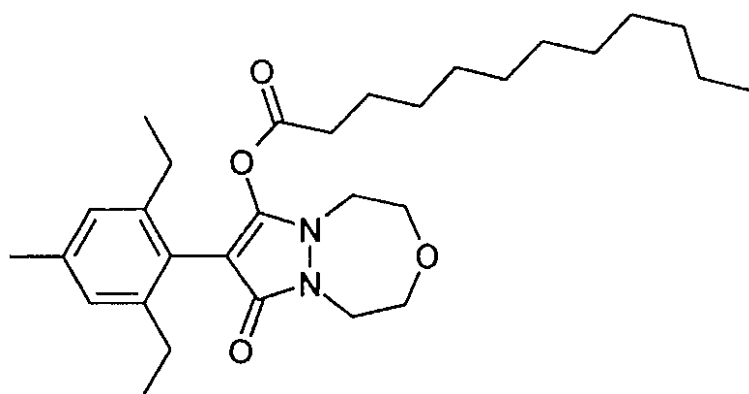
以下の例は本発明を更に例示するものであり、本発明を限定するものではない。

【0106】

調製例：

例P1：化合物1.01の調製

【化45】



20

30

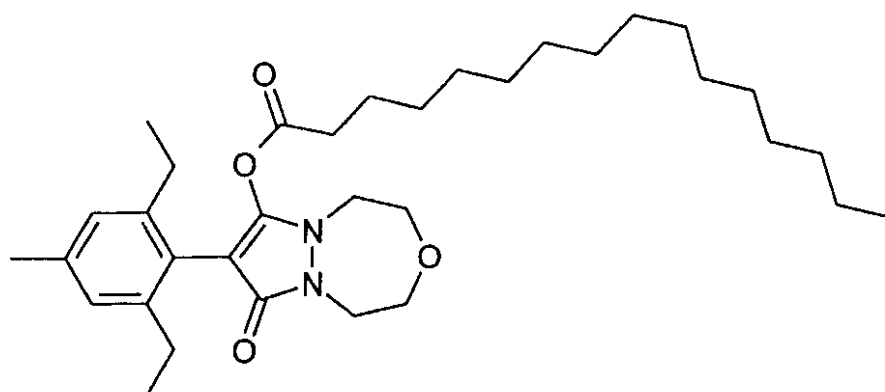
トリエチルアミン(1.0 ml, 7.17 mmol)およびスパチュラ先端量の4-N, N-ジメチルアミノピリジンを、テトラヒドロフラン50 ml中の8-(2,6-ジエチル-4-メチル-フェニル)-テトラヒドロ-ピラゾロ-[1,2-d][1,4,5]オキサジアゼピン-7,9-ジオン(2.00 g, 6.4 mmol)の溶液に加える。攪拌しながら、塩化ラウロイル(1.7 ml, 7.16 mmol)を20℃で滴下する。直後に白色沈殿が生成する。薄層クロマトグラフィは、反応が5分後に完了したことを示す。反応混合物を吸引濾過し、濾液をエバポレーションにより濃縮する。残留物をヘキサン及び少量のジエチルエーテル中でスラリー化し、吸引濾過して、減圧中で乾燥する。それにより得られた結晶性物質は、融点106~107℃(MS(電子スプレー): m/z = 499 [M+H]⁺)である。

40

【0107】

例P2：化合物1.02の調製

【化 4 6】



10

トリエチルアミン (1 . 4 m l , 1 0 m m o l) およびスパチュラ先端量の 4 - N , N - ジメチルアミノピリジンを、テトラヒドロフラン 5 0 m l 中の 8 - (2 , 6 - ジエチル - 4 - メチル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ - [1 , 2 - d] [1 , 4 , 5] オキサジアゼピン - 7 , 9 - ジオン (2 . 0 0 g , 6 . 4 m m o l) の溶液に加える。攪拌しながら、塩化パルミトイル (2 . 2 m l , 7 . 2 4 m m o l) を 2 2 で滴下する。直後に白色沈殿が生成する。薄層クロマトグラフィは、反応が 5 分後に完了したことが示す。反応混合物をエバポレーションにより濃縮し、その残留物を酢酸エチル / ヘキサン混合物を使用して短シリカゲルカラムでクロマトグラフ処理する。生成物をペンタン中でスラリー化し、吸引濾過して、減圧中で乾燥する。それにより得られた結晶性物質は、9 1 ~ 9 2 で融解する (M S (電子スプレー) : $m / z = 555 [M + H]^+$)。

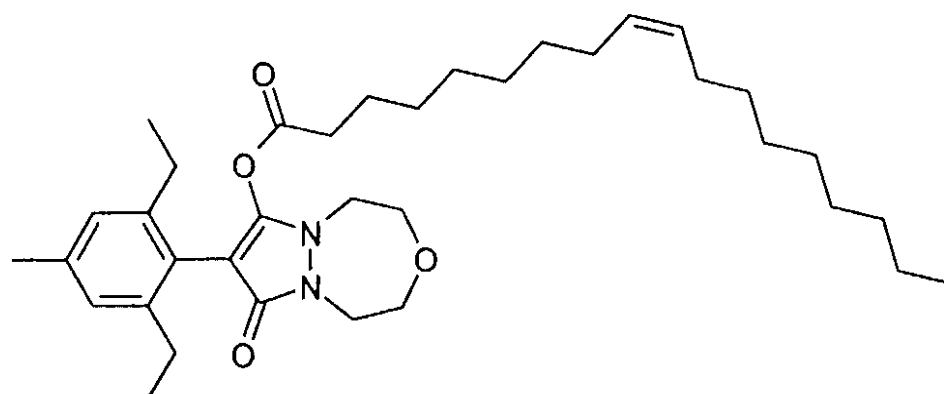
20

【 0 1 0 8 】

例 P 3 : 化合物 1 . 0 3 の調製

【化 4 7】

30



40

トリエチルアミン (1 m l , 7 . 1 m m o l) およびスパチュラ先端量の 4 - N , N - ジメチルアミノピリジンを、テトラヒドロフラン 4 0 m l 中の 8 - (2 , 6 - ジエチル - 4 - メチル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ - [1 , 2 - d] [1 , 4 , 5] オキサジアゼピン - 7 , 9 - ジオン (1 . 9 0 g , 6 . 0 m m o l) の溶液に加える。攪拌しながら、テトラヒドロフラン 1 0 m l 中の塩化オレオイル (7 . 0 m m o l) (塩化オキサリルの作用下でオレイン酸より得られたもの) の溶液を 2 0 で滴下する。直後に白色

50

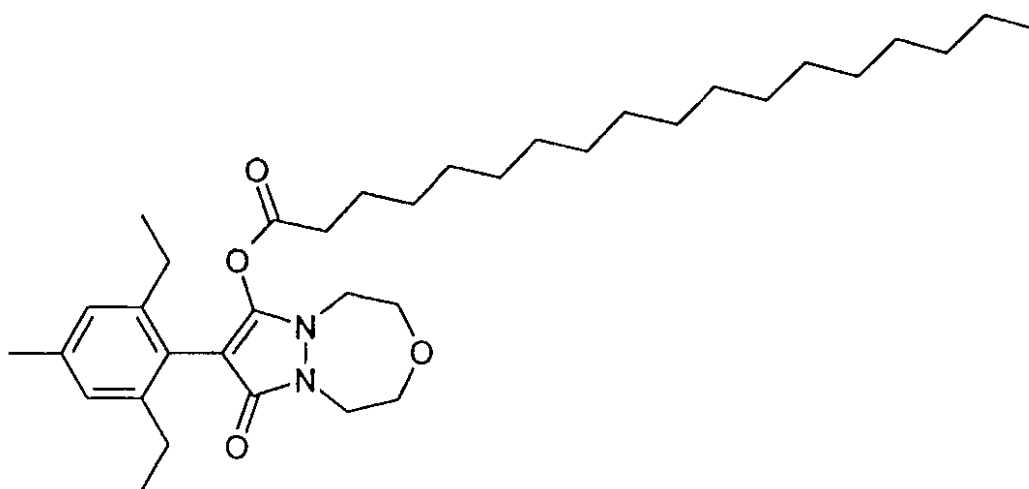
沈殿が生成する。薄層クロマトグラフィは、反応が 10 分後に完了したことを示す。反応混合物をフリット上で吸引濾過し、残留物をテトラヒドロフランで濯ぐ。濾液をエバポレーションにより濃縮し、残留物にヘキサン (50 ml) を加える。少部分のジエチルエーテルを生成物が溶解するまで加える。その溶液を、加熱することなく Rotavapor を使用するエバポレーションにより部分的に濃縮すると、白色懸濁液が生成する。その懸濁液を遠心分離し、溶液を除去する。固形物をヘキサン中で懸濁させ、遠心分離後に溶液を除去する。減圧中で乾燥後、所望生成物が融点 73 ~ 74 を有するワックス状固形物として得られる。

【0109】

例 P 4 : 化合物 1.04 の調製

10

【化 48】



20

テトラヒドロフラン 30 ml 中の 8 - (2, 6 - ジエチル - 4 - メチル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1, 2 - d] [1, 4, 5] オキサジアゼピン - 7, 9 - ジオン (1.00 g, 3.2 mmol)、トリエチルアミン (0.7 ml, 5.0 mmol) およびスパチュラ先端量の 4 - N, N - ジメチルアミノピリジンの溶液に、Kugelrohr オープンを使用して新たに蒸留した塩化ステアロイル (1.2 ml, 3.6 mmol) を 20 で加える。30 分間攪拌した後、反応混合物をエバポレーションにより濃縮し、そして残留物をジクロロメタン中に溶解させ、酢酸エチル / ヘキサン混合物を使用する短シリカゲルカラム上で迅速にクロマトグラフ処理する。純粋なフラクションをペンタン中でスラリー化し、吸引濾過する。所望生成物が融点 32 ~ 33 を有する白色結晶として単離される。

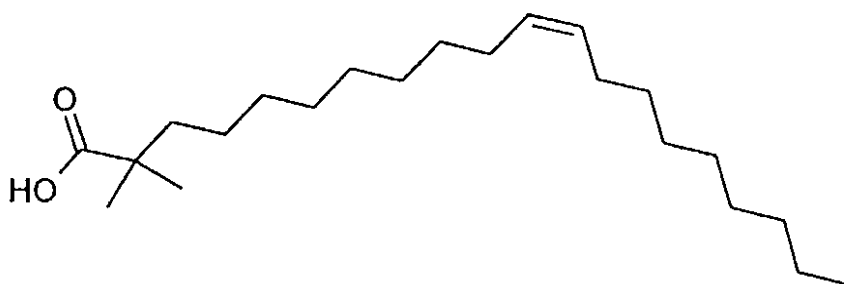
30

【0110】

例 P 5 : 化合物 1.05 a の調製

40

【化 4 9】



10

メカニカルスターラを有する装置内で、テトラヒドロフラン 15 ml 中の水素化ナトリウム (0.20 g, オイル中 60%, 4.95 mmol) の懸濁液に、N, N - ジイソプロピルアミン (0.464 g, 4.6 mmol) を加える。0 で、イソ酪酸 (0.396 g, 4.5 mmol) を加える。反応混合物を 65 で 20 分間加熱し、次に 0 に冷却し、n - ブチルリチウム (ヘキサン中 1.6 M, 2.81 ml, 4.5 mmol) で滴下処理する。白色懸濁液が淡黄色溶液になる。20 分後、温度を 30 に上げ、そして 15 分後、再び 0 に下げる。テトラヒドロフラン 4 ml 中の臭化オレイル (1.49 g, 4.5 mmol) の溶液を加える。15 分後、温度を 30 に上げる。1 時間後、該バッチを再び冷却し、水を加えて相分離させる。有機相を水 / ジエチルエーテルにより抽出する。水相を組み合わせてジエチルエーテルにより抽出し、2 N 塩酸を用いて酸性にし、再びジエチルエーテルにより抽出する。最終抽出物を塩水と共に振盪し、硫酸ナトリウム上で乾燥し、エバポレーションにより濃縮する。所望される酸が無色オイルの形態で得られる。

20

分光学的データ：

^1H NMR (CDCl₃, 300 MHz) : δ = 5.40 - 5.30 (m, 2 H, ビニル), 2.08 - 1.95 (m, 4 H, アリル), 1.58 - 1.47 (m, 2 H, カルボン酸に対し 位の CH_2), 1.40 - 1.20 (m, 24 H), 0.88 (t, 3 H, メチル)。

30

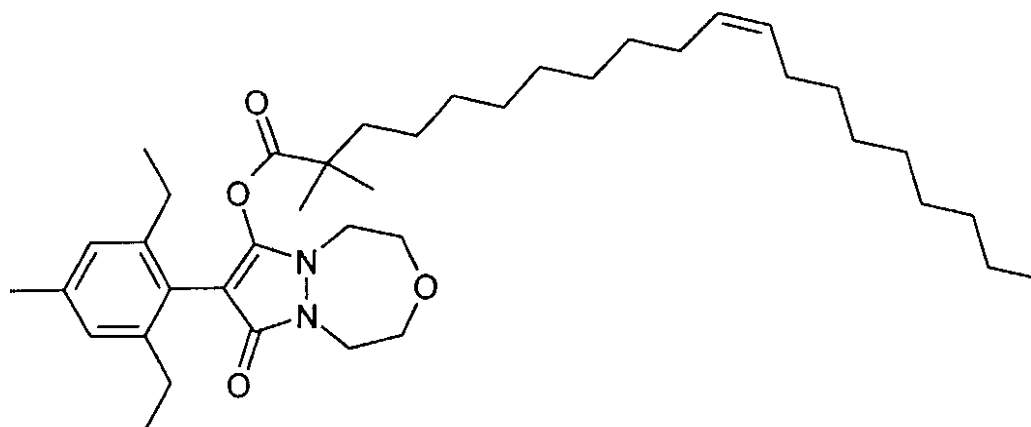
^{13}C NMR (CDCl₃, 75 MHz) : δ = 185.0 (COOH), 130.3 および 130.2 (C = C)。

MS (電子スプレー) : m/z = 337 [M - H]⁻。

【0111】

化合物 1.05 b の調製

【化 5 0】



10

テトラヒドロフラン 300 ml 中の 8 - (2 , 6 - ジエチル - 4 - メチル - フェニル)
 - テトラヒドロ - ピラゾロ [1 , 2 - d] [1 , 4 , 5] オキサジアゼピン - 7 , 9 - ジ
 オン (6 . 4 4 g , 2 0 . 3 6 m m o l) 、 トリエチルアミン (5 . 2 m l , 3 7 . 3 1
 m m o l) およびスパチュラ先端量の 4 - N , N - ジメチルアミノピリジンの溶液に、 c
 i s - 2 , 2 - ジメチル - イコサ - 1 1 - エン酸 (2 1 . 3 8 m m o l) と塩化オキサリ
 ルより調製された酸塩化物のジエチルエーテル溶液 2 5 m l を、 2 0 で加える。 3 0 分
 間攪拌した後、反応混合物を吸引濾過し、残留物をジエチルエーテルで濯ぐ。濾液をエバ
 ポレーションにより濃縮し、 2 5 % 酢酸エチルと 7 5 % ヘキサンの混合物を使用してシリ
 カゲルカラム上でクロマトグラフ処理 (H P L C) する。所望生成物が黄色っぽいオイル
 として単離される。

分光学的データ：

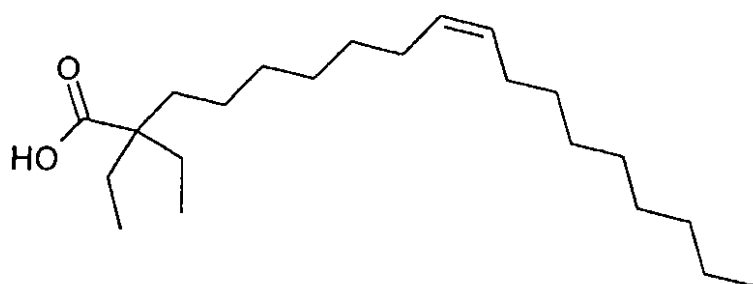
$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) : δ = 6 . 9 0 (s , 2 H , アリール) , 5
 . 3 7 (m , 2 H , ビニル) , 4 . 2 8 - 4 . 2 3 (m , 2 H) , 3 . 9 5 - 3 . 8 9 (30
 m , 2 H) , 3 . 8 8 - 3 . 7 8 (m , 4 H) , 2 . 6 0 - 2 . 3 5 (m , 4 H , Ar -
 CH₂) , 2 . 2 9 (s , 3 H , Ar - CH₃) , 2 . 0 8 - 1 . 9 7 (m , 4 H , アリル
) 。

MS (電子スプレー) : m/z = 1 2 7 4 [2 M + H]⁺ , 6 3 8 [M + H]⁺。

【 0 1 1 2 】

例 P 6 : 化合物 1 . 0 6 a の調製

【化 5 1】



40

テトラヒドロフラン 100 ml 中の水素化ナトリウム (オイル中 6 0 % , 0 . 4 7 g , 50

11.7 mmol) の懸濁液に、攪拌しながら、N, N - ジイソプロピルアミン (1.11 g, 11.0 mmol) および次にオレイン酸 (3.00 g, 10.6 mmol) を 0 ~ 5 でゆっくりと滴下する。反応混合物を 65 で 15 分間加熱する。その懸濁液を 0 に冷却し、n - ブチルリチウム溶液 (ヘキサン中 1.6 M, 10.0 ml, 16.0 mmol) をゆっくり滴下する。15 分後、得られた黄色溶液を 35 ~ 40 で 30 分間加熱し、再び 0 に冷却し、そしてテトラヒドロフラン 5 ml 中に溶解された臭化エチル (1.74 g, 16.0 mmol) で処理し、20 で終夜攪拌する。その白色懸濁液を再び 0 に冷却し、そして更なる部分の n - ブチルリチウム溶液 (ヘキサン中 1.6 M, 10.0 ml, 16.0 mmol) を滴下する。反応混合物を 35 ~ 40 で 30 分間加熱し、再び 0 に冷却し、そしてテトラヒドロフラン 5 ml 中に溶解された臭化エチル (1.74 g, 16.0 mmol) で処理する。(薄層クロマトグラフィにより) 反応が完了していないので、ブチルリチウム溶液と臭化エチルの連続した添加を、予定される同一温度および同一量を使用して更に 2 回行った。反応が完了したときに、反応混合物に水を加えて相分離させる。有機相を水 / ジエチルエーテルにより抽出する。水相を組み合わせ、ジエチルエーテルにより抽出し、2 N 塩酸を用いて酸性にし、再びジエチルエーテルにより抽出する。最終抽出物を塩水と共に振盪し、硫酸ナトリウム上で乾燥し、エバポレーションにより濃縮する。所望される酸が無色オイルの形態で得られる。

分光学的データ:

^1H NMR (CDCl₃, 300 MHz): δ = 5.40 - 5.30 (m, 2 H, ビニル), 2.1 - 1.9 (m, 4 H, アリル), 1.7 - 1.5 (m, 6 H, カルボン酸に対し 位の H), 1.4 - 1.1 (m, 20 H), 1.0 - 0.75 (m, 9 H, メチル)。

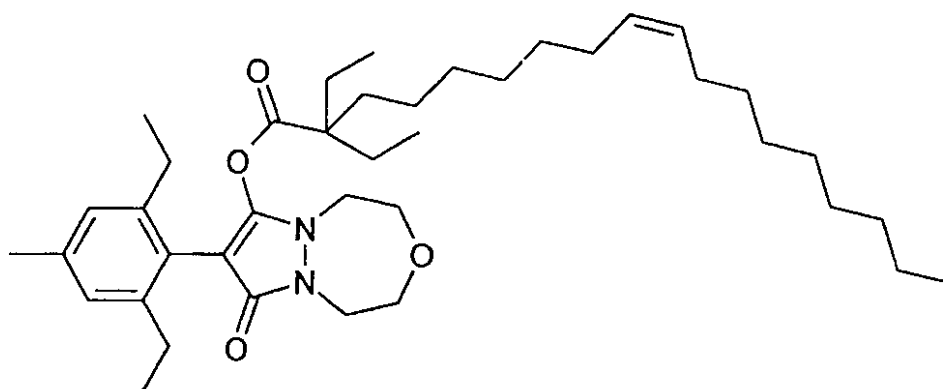
^{13}C NMR (CDCl₃, 75 MHz): δ = 184.0 (COOH), 130.0 および 129.8 (C = C)。

MS (電子スプレー): m/z = 337 [M - H]⁻。

【0113】

化合物 1.06b の調製

【化52】



40 ml テトラヒドロフラン中の 8 - (2, 6 - ジエチル - 4 - メチル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1, 2 - d] [1, 4, 5] オキサジアゼピン - 7, 9 - ジオン (1.62 g, 5.12 mmol)、トリエチルアミン (0.83 ml, 5.94 mmol) およびスパチュラ先端量の 4 - N, N - ジメチルアミノピリジンの溶液に、cis - 2, 2 - ジエチル - オクタデカ - 9 - エン酸 (5.91 mmol) と塩化オキサリルより調製された酸塩化物のテトラヒドロフラン溶液 30 ml を、20 で加える。30 分間攪拌した後、反応混合物を吸引濾過し、残留物をジエチルエーテルで濯ぐ。濾液を加熱す

ることなく Rotavapor を使用してエバポレーションにより濃縮し、10%酢酸エチル / 90%ヘキサンから100%酢酸エチルまでの勾配を使用して短シリカゲルカラム上でクロマトグラフ処理する。所望生成物が黄色っぽいオイルとして単離される。

分光学的データ：

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) : δ = 6.85 (s, 2H, アリール), 5.40 - 5.25 (m, 2H, ビニル), 2.6 - 2.3 (m, 4H, ベンジル), 2.28 (s, 3H, ベンジル)。

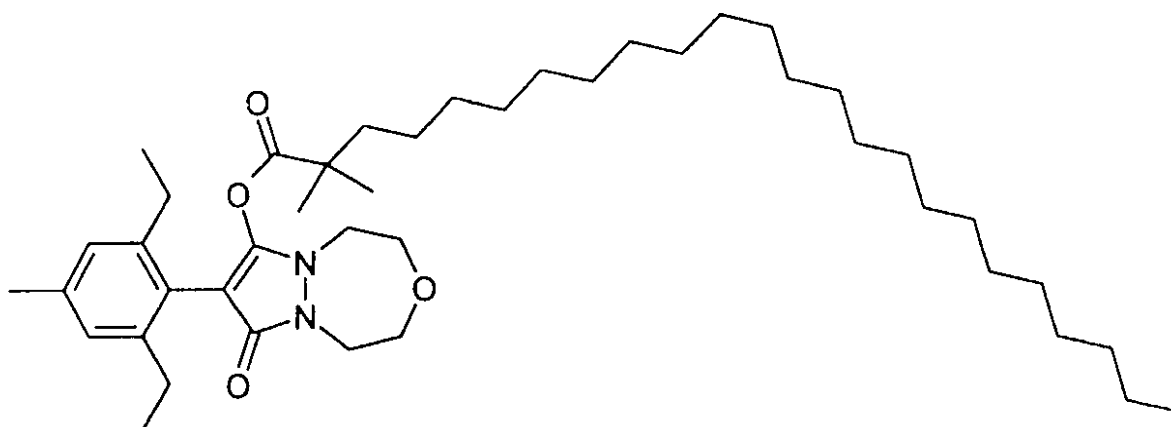
MS (電子スプレー) : m/z = 1274 $[2M + H]^+$, 638 $[M + H]^+$ 。

【0114】

例 P 7 : 化合物 1.07 の調製

10

【化53】



20

8 - (2, 6 - ジエチル - 4 - メチル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラゾロ [1, 2 - d] [1, 4, 5] オキサジアゼピン - 7, 9 - ジオン (1.0 g, 0.00316 mol)、塩化 2, 2 - ジメチルテトラコサノイル (1.58 g, トルエン中で 2, 2 - ジメチルテトラコサン酸と塩化チオニルより調製されたもの) およびトリエチルアミン (0.38 g, 0.0038 mmol) を、アセトニトリル 25 ml 中で混合し、20 で 20 時間攪拌する。反応混合物を希塩酸 300 ml 中に注ぎ、酢酸エチルにより 2 回抽出する。有機相を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥し、エバポレーションにより濃縮する。その粗生成物を、酢酸エチル / ヘキサン混合物を使用してシリカゲルカラム上でクロマトグラフ処理する。融点 80 ~ 82 を有する結晶性物質の形態で当該物質が単離される。

30

分光学的データ：

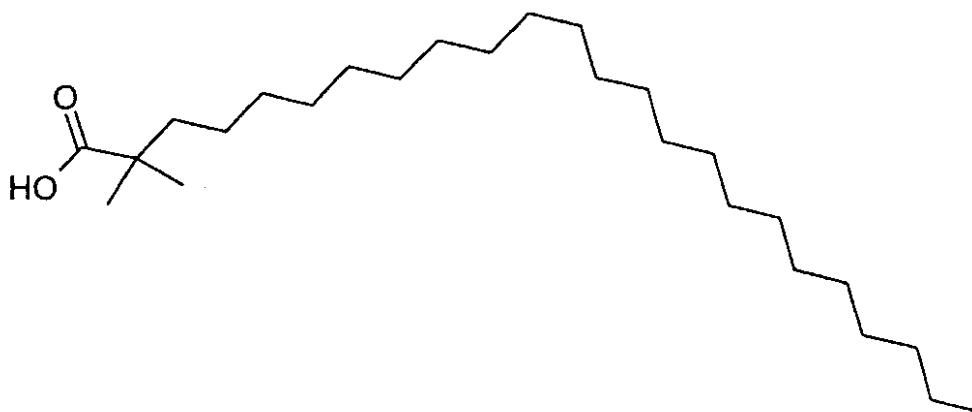
$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) : δ = 6.90 (s, 2H, アリール), 4.30 - 4.20 (m, 2H), 3.99 - 3.92 (m, 2H), 3.90 - 3.82 (m, 4H), 2.61 - 2.37 (m, 4H, Ar - CH_2 - CH_3), 2.29 (s, 3H, ベンジル), 1.4 - 1.2 (m, 42H), 1.13 (t, J = 13 Hz, 6H, Ar - CH_2 - CH_3), 1.04 (s, 6H, -メチル), 0.90 (t, J = 12 Hz, 3H, メチル)。

40

【0115】

例 P 8 : 化合物 1.08 a の調製

【化 5 4】



10

テトラヒドロフラン 100 ml 中の N, N - ジイソプロピルアミン (5 . 0 6 g , 0 . 0 5 m o l) の溶液を - 3 0 に冷却し、そして温度が - 1 0 を超えて上昇しないように n - ブチルリチウム (ヘキサン中 1 . 6 M , 3 0 m l , 0 . 0 4 8 m o l) を加える。テトラヒドロフラン 2 0 m l 中に溶解されたイソ酪酸 (2 . 0 2 g , 0 . 0 2 2 9 m m o l) を 1 5 分にわたって滴下する。反応混合物を次に 5 0 に加熱し、9 0 分後に 2 0 に冷却する。テトラヒドロフラン 2 0 m l 中の 1 - プロモドコサン (9 . 7 4 g , 0 . 0 2 5 m o l) の溶液を滴下する。2 0 時間攪拌した後に、反応混合物に 1 0 0 m l の飽和塩化アンモニウム水溶液および 8 m l の濃塩酸溶液を加える。相が分離され、有機相を塩水と共に振盪することにより抽出し、硫酸ナトリウム上で乾燥し、エバポレーションにより濃縮する。当該酸がヘキサンから再結晶される。

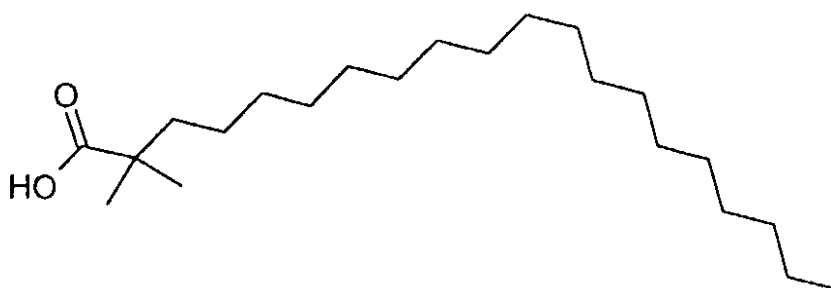
20

【 0 1 1 6 】

例 P 9 : 化合物 1 . 0 9 a の調製

【化 5 5】

30



40

テトラヒドロフラン 7 0 m l 中の水素化ナトリウム (オイル中 6 0 % , 2 . 2 g , 5 5 m m o l) および N, N - ジイソプロピルアミン (7 . 3 m l , 5 0 m m o l) の懸濁液に、2 0 で、イソ酪酸 (4 . 6 5 m l , 5 0 m m o l) を加える。6 5 に加熱した後に、該バッチを 0 に冷却し、そして n - ブチルリチウム (ヘキサン中 2 . 0 M , 2 5 m l , 5 0 m m o l) を滴下する。得られた溶液を 4 0 で 3 0 分間加熱し、次に 0 に冷却した後に、テトラヒドロフラン 4 0 m l 中の 1 - プロモオクタデカン (1 7 . 5 g , 5 2 . 5 m m o l) を加える。反応混合物を 3 5 で 1 時間攪拌し、次に冷却し、氷 / 水混合物中に注ぎ、2 N 水酸化ナトリウム溶液を加える。その懸濁液を吸引濾過し、残留物を 1 N 水酸化ナトリウム溶液、水およびヘキサンで洗浄し、それを次にジエチルエーテル /

50

4 N 塩酸中で攪拌する。相が分離され、水相をジエチルエーテルにより 2 回抽出し、有機相を組み合わせて水と共に、次に塩水と共に振盪することにより抽出し、硫酸ナトリウム上で乾燥し、エバポレーションにより濃縮する。

分光学的データ：

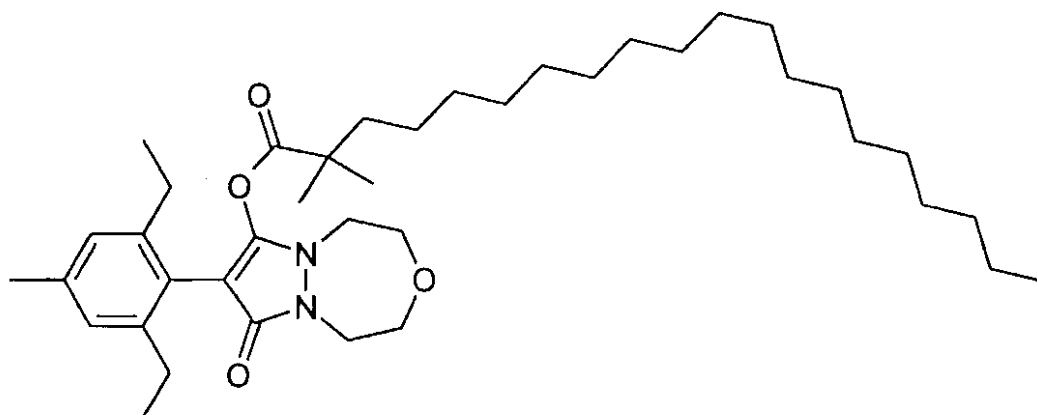
$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) : 1.20 (s, 6H, -メチル)。

MS (電子スプレー) : $m/z = 339 [M - H]^-$, 385 $[M + \text{HCOO}]^-$ 。

【0117】

化合物 1.09b の調製

【化56】



10

20

手順は例 P7 と類似であり、以下の分光学的データを有する所望化合物が得られる：

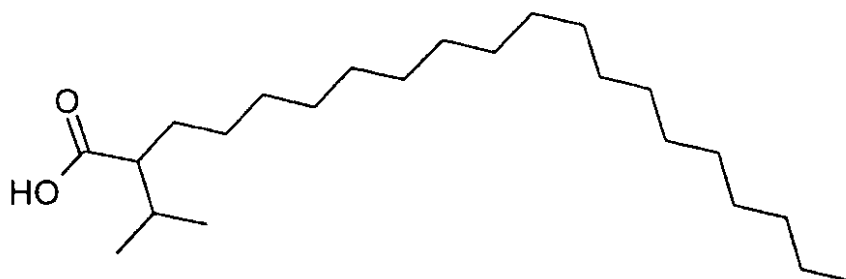
$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) : 6.87 (s, 2H, アリール), 2.29 (s, 3H, Ar-CH₃), 1.12 (t, $J = 13\text{ Hz}$, 6H, Ar-CH₂-CH₃), 1.05 (s, 6H, -メチル) ; MS (電子スプレー) : $m/z = 640 [M + H]^+$ 。

30

【0118】

例 P10 : 化合物 1.10a の調製

【化57】



40

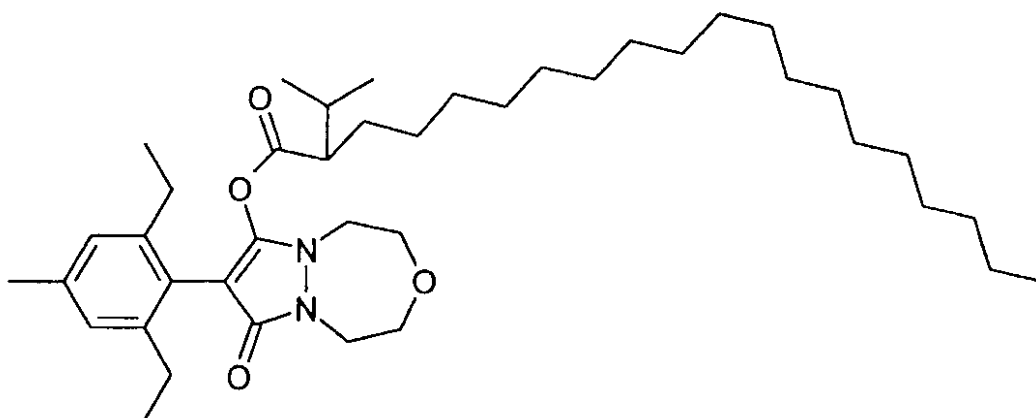
手順は例 P9a の通りであり、以下の分光学的データを有する所望化合物が得られる：

MS (電子スプレー) : $m/z = 353 [M - H]^-$, 399 $[M + \text{HCOO}]^-$ 。

【0119】

化合物 1.10b の調製

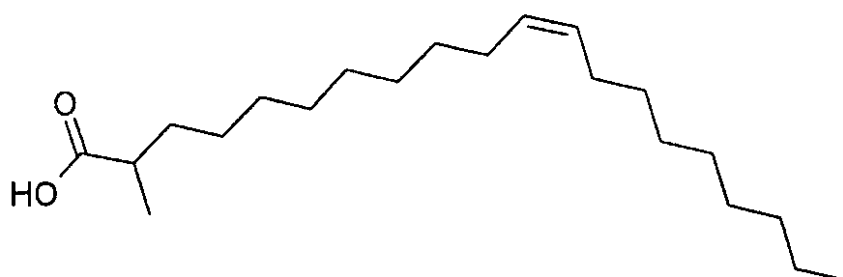
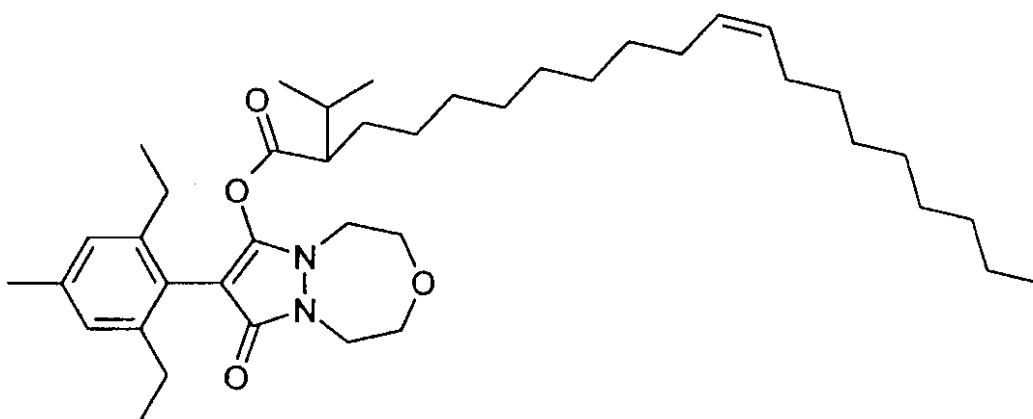
10



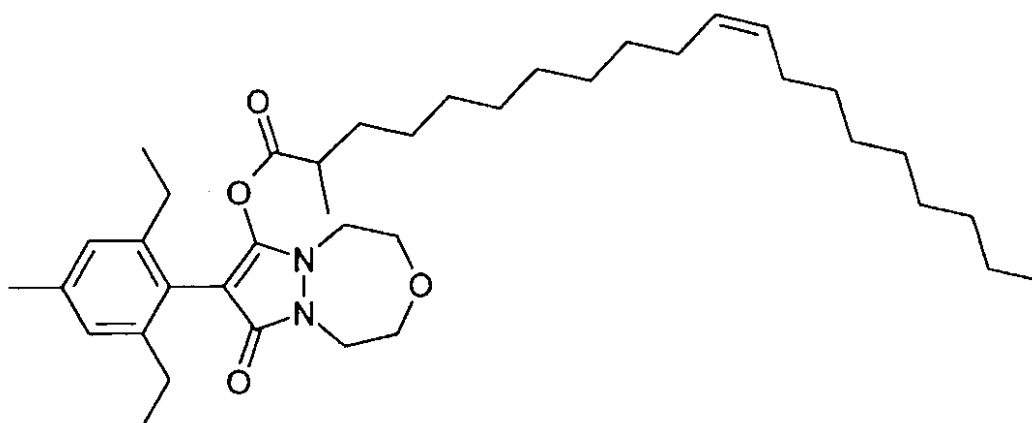
20

30

40



【化 6 2】



10

手順は例 P 7 の通りであり、以下の分光学的データを有する所望化合物が得られる：

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , 300 MHz) : δ = 6.87 (s, 2H, アリール), 5.42 - 5.33 (m, 2H, オレフィン), 2.63 - 2.36 (m, 4H, アリール - CH_2 - CH_3), 2.30 (s, 3H, アリール - CH_3), 1.01 (d, 3H, -メチル), 0.90 (t, 3H, メチル) ;

MS (電子スプレー) : m/z = 623 [$\text{M} + \text{H}$] $^+$ 。

【0124】

生物学的な例

単子葉草と双子葉草および春蒔きコムギ (summer wheat, Lona) をプラスチックポット内の標準土壌に蒔く。種蒔きの直後に、試験化合物を (追加的な界面活性化合物を伴わないで) EC 125 および WP 10 として適用する。適用レートは 125 g 活性物質 / ha である。試験植物を次に、最適条件の下、温室内で生長させる。適用から 20 日後に評価を行う。100 とは、問題とする植物に対する 100 % 障害を表わす。

30

試験植物：コヌカグサ属 (Agrostis) (Agr), スズメノテッポウ属 (Alopecurus) (Alo), クサヨシ属 (Phalaris) (Pha)、ロリウム属 (Lolium) (Lol) およびエイコログサ属 (Setaria) (Set)。

【0125】

【表 2 7】

表21：125g/haの適用レートにおける除草作用

	化合物 A EC 125	化合物1.03 WP 10	化合物1.12b WP 10	化合物1.05b WP 10
コムギ	20	10	10	0
Agr	95	98	95	80
Alo	100	90	90	80
Pha	100	100	100	100
Lol	98	90	80	70
Set	100	100	90	70

40

化合物 A は 8 - (2, 6 - ジエチル - 4 - メチル - フェニル) - テトラヒドロピラゾロ 50

[1 , 2 - d] [1 , 4 , 5] オキサジアゼピン - 7 , 9 - ジオンである。

【 0 1 2 6 】

化合物 A と比較して、用いられた本発明による化合物はコムギに関しては低い植物毒性を示す一方、雑草に関してはほぼ同等の活性を有する。

【 手 続 補 正 書 】

【 提 出 日 】 平成 16 年 7 月 28 日 (2004 . 7 . 28)

【 手 続 補 正 1 】

【 補 正 対 象 書 類 名 】 特 許 請 求 の 範 囲

【 補 正 対 象 項 目 名 】 全 文

【 補 正 方 法 】 変 更

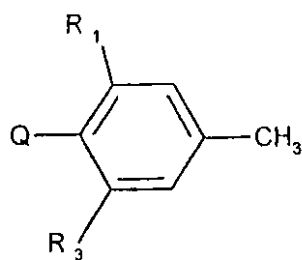
【 補 正 の 内 容 】

【 特 許 請 求 の 範 囲 】

【 請 求 項 1 】

下記式 I :

【 化 1 】



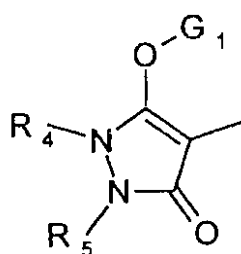
(I),

[式 中

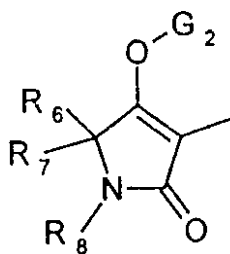
R₁ および R₃ は各々他とは独立して、エチル、ハロエチル、エチニル、C₁ - C₂ アルコキシ、C₁ - C₂ ハロアルコキシ、C₁ - C₂ アルキルカルボニル、C₁ - C₂ ヒドロキシアルキルまたは C₁ - C₂ アルコキシカルボニルであり；

Q は下記：

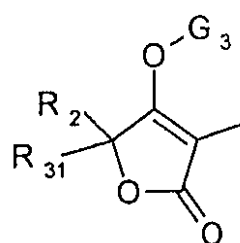
【 化 2 】



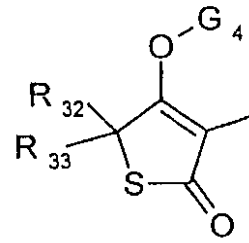
(Q₁),



(Q₂),

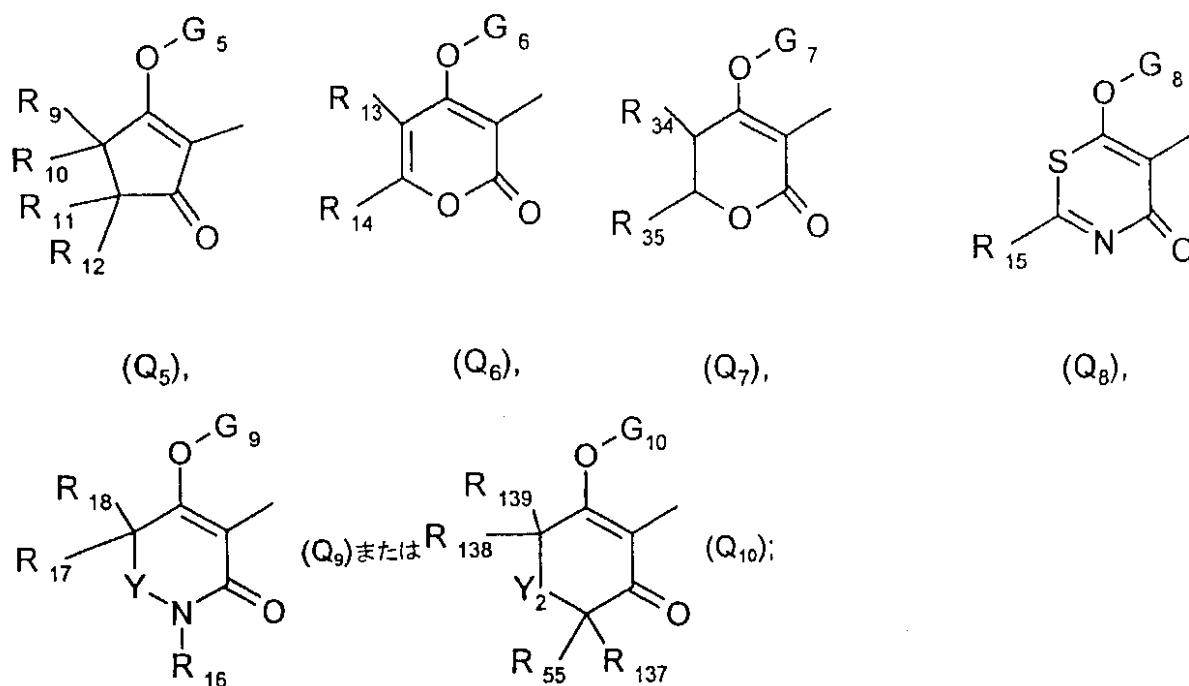


(Q₃),



(Q₄),

【化 3】



の基であり；

R₄ および R₅ は各々他とは独立して、C₁ - C₁₀ アルキル、C₂ - C₁₀ アルケニル、C₂ - C₁₀ アルキニル、C₁ - C₁₀ ハロアルキル、C₂ - C₁₀ アルコキシアリル、C₃ - C₁₀ アルケニルオキシアリル、C₃ - C₁₀ アルキニルオキシアリル、C₂ - C₁₀ アルキルチオアルキル、C₂ - C₁₀ アルキルスルフィニルアルキル、C₂ - C₁₀ アルキルスルホニルアルキル、C₂ - C₁₀ アルキルカルボニルアルキル、C₂ - C₁₀ - N - アルコキシ - イミノアルキル、C₂ - C₁₀ アルコキシカルボニルアルキル、C₁ - C₁₀ アミノアルキル、C₃ - C₁₀ ジアルキルアミノアルキル、C₂ - C₁₀ アルキルアミノアルキル、C₁ - C₁₀ シアノアルキル、C₄ - C₁₀ シクロアルキルアルキル、C₁ - C₁₀ フェニルアルキル、C₁ - C₁₀ ヘテロアリールアルキル、C₁ - C₁₀ フェノキシアリル、C₁ - C₁₀ ヘテロアリールオキシアリル、C₁ - C₁₀ アルキリデンアミノオキシアリル、C₁ - C₁₀ ニトロアルキル、C₁ - C₁₀ トリアルキルシリルアルキル、C₂ - C₁₀ アルキルアミノカルボニルアルキル、C₂ - C₁₀ ジアルキルアミノカルボニルアルキル、C₂ - C₁₀ アルキルアミノカルボニルオキシアリル、C₃ - C₁₀ ジアルキルアミノカルボニルオキシアリル、C₂ - C₁₀ アルコキシカルボニルアミノアルキル、C₁ - C₁₀ - N - アルコキシカルボニル - N - アルキルアミノ - アルキル、C₁ - C₁₀ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；あるいは、

R₄ および R₅ はそれらが結合する原子と一緒に、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよく、そして酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい 2 ~ 6 炭素原子からなる縮合した又はスピロ結合したアルキレンまたはアルケニレン鎖を追加的に含んでもよい 5 ~ 7 員環を形成し、当該環はフェニルにより又はベンジルにより置換されてよく、該フェニルおよびベンジルの各々もまたハロゲン、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ ハロアルキル、C₃ - C₆ シクロアルキル、ヒドロキシ、C₁ - C₆ アルコキシ、C₁ - C₆ アルコキシ - C₁ - C₆ アルコキシ、C₁ - C₆ ハロアルコキシにより又はニトロにより置換されてよく、

R₂、R₆ および R₃₂ は各々他とは独立して、C₁ - C₁₀ アルキル、C₂ - C₁₀ アルケニル、C₂ - C₁₀ アルキニル、C₁ - C₁₀ ハロアルキル、C₂ - C₁₀ アルコキシアリル、C₃ - C₁₀ アルケニルオキシアリル、C₃ - C₁₀ アルキニルオキシアリル、C₂

- C_{10} アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリアルまたはヘテロアリアルであり；

R_7 、 R_{31} および R_{33} は各々他とは独立して、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニルまたは $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキルであり、

R_8 は、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリアルまたはヘテロアリアルであり；あるいは、

R_6 および R_7 、または R_2 および R_{31} 、または R_{32} および R_{33} はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい飽和 3 ~ 7 員環を形成し；あるいは、 R_6 および R_8 はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい 5 ~ 7 員環を形成し；

R_9 、 R_{10} 、 R_{11} および R_{12} は各々他とは独立して、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリアルまたはヘテロアリアルであり；あるいは、

R_9 および R_{11} 、または R_9 および R_{10} はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい 5 ~ 7 員環を形成し；

R_{13} 、 R_{14} 、 R_{34} および R_{35} は各々他とは独立して、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリアルまたはヘテロアリアルであり；あるいは、

R_{13} および R_{14} 、または R_{34} および R_{35} はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい 5 ~ 7 員環を形成し；

R_{15} は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_1 - C_{10}$ アミノアルキル、 $C_3 - C_{10}$ ジアルキルアミノアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルアミノアルキル、 $C_1 - C_{10}$ シアノアルキル、 $C_4 - C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 - C_{10}$ フェニルアルキル、 $C_1 - C_{10}$ ヘテロアリアルアルキル、 $C_1 - C_{10}$ フェノキシアルキル、 $C_1 - C_{10}$ ヘテロアリアルオキシアルキル、 $C_1 - C_{10}$ ニトロアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリアルまたはヘテロアリアルであり；

R_{16} は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリアルまたはヘテロアリアルであり；

R_{17} は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアル

キル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；

R_{18} は、水素、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ アルキルまたは $C_1 - C_{10}$ アルコキシアルキルであり；あるいは、

R_{17} および R_{18} はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい 3 ~ 7 員環を形成し；

Y は酸素、硫黄、 $C - R_{19}$ または $N - R_{36}$ であり；

R_{19} および R_{36} は各々他とは独立して、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、フェニルまたはヘテロアリールであり；あるいは、

R_{18} および R_{19} 、または R_{18} および R_{36} はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい飽和 5 ~ 7 員環を形成し；

G_1 、 G_2 、 G_3 、 G_4 、 G_5 、 G_6 、 G_7 、 G_8 、 G_9 および G_{10} は各々他とは独立して、 $-C(X_1)-R_{20}$ 、 $-C(X_2)-X_3-R_{21}$ 、 $-C(X_4)-N(R_{22})-R_{23}$ 、 $-SO_2-R_{24}$ 、 $-S(R_{200})_3$ 、 $-N(R_{300})_4$ 、 $-P(R_{400})_4$ 、 $-P(X_5)(R_{25})-R_{26}$ または $-CH_2-X_6-R_{27}$ であり；

X_1 、 X_2 、 X_3 、 X_4 、 X_5 および X_6 は各々他とは独立して、酸素または硫黄であり；

R_{20} 、 R_{21} 、 R_{24} 、 R_{27} ならびに置換基 R_{200} の少なくとも 1 つ、置換基 R_{300} の少なくとも 1 つ、置換基 R_{400} の少なくとも 1 つ、置換基 R_{22} および R_{23} の少なくとも 1 つ、および置換基 R_{25} および R_{26} の少なくとも 1 つは各々、 $C_9 - C_{32}$ アルキル、1 個以上の $C_1 - C_8$ アルキル基により置換された $C_9 - C_{32}$ アルキル、 $C_9 - C_{32}$ アルケニル、または 1 個以上の $C_1 - C_8$ アルキル基により置換された $C_9 - C_{32}$ アルケニルであり、

残りの置換基 R_{200} は追加的に、 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、フェニルであるか、またはアルキル、ハロゲン、アルコキシ、チオアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、シアノにより又はニトロにより置換されたフェニルであり、あるいは 2 つの置換基 R_{200} がそれらの結合する硫黄原子と一緒にあって、酸素、窒素または硫黄原子により分断されてよい 5 ~ 8 員環を形成し、

残りの置換基 R_{300} は R_{200} について定義された通りであるが、追加的に水素の意味であってよく、

残りの置換基 R_{400} は追加的に、 $C_1 - C_8$ アルキル、フェニルであるか、またはアルキル、ハロゲン、アルコキシ、チオアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、シアノにより又はニトロにより置換されたフェニルであり、あるいは 2 つの置換基 R_{400} がそれらの結合するリン原子と一緒にあって、酸素、窒素または硫黄原子により分断されてよい 5 ~ 8 員環を形成し、

R_{22} および R_{23} は追加的に、各々他とは独立して、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1 - C_{10}$ シアノアルキル、 $C_1 - C_{10}$ ニトロアルキル、 $C_1 - C_{10}$ アミノアルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_4 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_4 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルスルホキシル、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルキリデンアミノ、 $-O-X_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルカルボニル、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アミノカルボニル、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルカルボニル、

ミノ - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルカルボニル - ($C_2 - C_5$ アルキル) - アミノアルキル、 $C_3 - C_6$ トリアルキルシリル - $C_1 - C_5$ アルキル、フェニル - $C_1 - C_5$ アルキル、ヘテロアリール - $C_1 - C_5$ アルキル、フェノキシ - $C_1 - C_5$ アルキル、ヘテロアリールオキシ - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_5$ アルケニル、 $C_2 - C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、あるいはフェニル、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたフェニル、あるいはヘテロアリールまたはヘテロアリールアミノ、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたヘテロアリールまたはヘテロアリールアミノ、あるいはジヘテロアリールアミノ、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたジヘテロアリールアミノ、あるいはフェニルアミノ、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたジフェニルアミノ、あるいは $C_3 - C_7$ シクロアルキルアミノ、ジ - $C_3 - C_7$ シクロアルキルアミノまたは $C_3 - C_7$ シクロアルコキシであり；

R_{25} および R_{26} は追加的に、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1 - C_{10}$ シアノアルキル、 $C_1 - C_{10}$ ニトロアルキル、 $C_1 - C_{10}$ アミノアルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルアミノ - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノ - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_4 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_4 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルスルホキシル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルスルホニル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルキリデンアミノ - オキシ - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルカルボニル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルコキシカルボニル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アミノ - カルボニル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノカルボニル - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルカルボニルアミノ - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルキルカルボニル - ($C_2 - C_5$ アルキル) - アミノアルキル、 $C_3 - C_6$ トリアルキルシリル - $C_1 - C_5$ アルキル、フェニル - $C_1 - C_5$ アルキル、ヘテロアリール - $C_1 - C_5$ アルキル、フェノキシ - $C_1 - C_5$ アルキル、ヘテロアリールオキシ - $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_2 - C_5$ アルケニル、 $C_2 - C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、あるいはフェニル、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたフェニル、あるいはヘテロアリールまたはヘテロアリールアミノ、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたヘテロアリールまたはヘテロアリールアミノ、あるいはジヘテロアリールアミノ、または $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノにより又はニトロにより置換されたジフェニルアミノ、あるいは $C_3 - C_7$ シクロアルキルアミノ、ジ - $C_3 - C_7$ シクロアルキルアミノ、 $C_3 - C_7$ シクロアルコキシ、 $C_1 - C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_5$ アルキルアミノ、 $C_2 - C_8$ ジアルキルアミノ、ベンジルオキシまたはフェノキシであり、前記ベンジルおよびフェニル基もまた $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、ハロゲン、シア

ノにより又はニトロにより置換されてよく；

Y_2 は酸素、硫黄、 $C - R_{140} - R_{141}$ または $N - R_{142}$ であり；

R_{55} は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；

R_{137} は、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニルまたは $C_1 - C_{10}$ アルコキシアルキルであり；あるいは、

R_{55} および R_{137} はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい 3 ~ 7 員環を形成し；

R_{138} および R_{139} は各々他とは独立して、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニルまたは $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキルであり；そして、

R_{140} および R_{141} は各々他とは独立して、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニルまたは $C_1 - C_{10}$ アルコキシアルキルであり；あるいは、

R_{55} および $C - R_{140}$ はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい飽和または不飽和 3 ~ 7 員環を形成し；

R_{142} は、水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_1 - C_{10}$ ハロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルコキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルケニルオキシアルキル、 $C_3 - C_{10}$ アルキニルオキシアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルチオアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；あるいは、

R_{55} および $N - R_{142}$ はそれらが結合する原子と一緒にあって、窒素、酸素および硫黄より選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含んでよい飽和または不飽和 3 ~ 7 員環を形成する]

の化合物、あるいは該化合物の栽培学的に許容される塩、異性体またはエナンチオマー。

【請求項 2】

不活性担体上に、除草剤として有効な量の式 I の化合物を含んでなる、除草および植物生長阻害組成物。

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.

PCT/EP 03/00555

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07D498/04

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D

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

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 01 17972 A (SZCZEPANSKI HENRY ; WENDEBORN SEBASTIAN (CH); MAETZKE THOMAS (CH);) 15 March 2001 (2001-03-15) Compounds 1.126, 1.149, 1.173, 1.196, 21.26, 21.101, 21.113 page 1, line 1 -page 7, line 21 ---	1-10
X	WO 01 17973 A (WENDEBORN SEBASTIAN ; MAETZKE THOMAS (CH); SYNGENTA PARTICIPATIONS) 15 March 2001 (2001-03-15) Compound Ib-65 page 1 -page 5 ---	1-10
X	EP 0 442 077 A (BAYER AG) 21 August 1991 (1991-08-21) page 3, line 1 -page 4, line 7; examples 68,69 --- -/--	1,3-10

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

A document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

E earlier document but published on or after the international filing date

L document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

O document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

P document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

X document of particular relevance: the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

Y document of particular relevance: the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

& document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

24 April 2003

Date of mailing of the international search report

02/05/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Usuelli, A

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.
PCT/EP 03/00555

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 008 540 A (UNION CARBIDE CORP) 5 March 1980 (1980-03-05) page 1, line 1 -page 2, line 8; example 5; table 1 ---	1,3-10
X	US 4 351 666 A (KOERWER JOHN F) 28 September 1982 (1982-09-28) column 1, line 35 -column 2, line 10; examples 27,73-76 ---	1,3-10
X	WO 96 20196 A (BAYER AG ; FISCHER REINER (DE); BRETSCHNEIDER THOMAS (DE); BECK GUN) 4 July 1996 (1996-07-04) Compound Ib-17 page 1, line 1 -page 3, line 5 ---	1,3-10
X	WO 00 78881 A (NOVARTIS ERFIND VERWALT GMBH ; SZCZEPANSKI HENRY (CH); NOVARTIS AG) 28 December 2000 (2000-12-28) page 16, paragraph 3 -page 17, paragraph 2 -----	5

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No.

PCT/EP 03/00555

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 0117972	A	15-03-2001	AU 7650300 A WO 0117972 A2 EP 1210333 A2 HU 0202573 A2	10-04-2001 15-03-2001 05-06-2002 28-11-2002
WO 0117973	A	15-03-2001	AU 7514600 A CN 1377358 T WO 0117973 A2 EP 1230245 A2 HU 0202844 A2	10-04-2001 30-10-2002 15-03-2001 14-08-2002 28-12-2002
EP 0442077	A	21-08-1991	DE 4004496 A1 BR 9100517 A DE 59009858 D1 EP 0442077 A2 JP 3038026 B2 JP 4211056 A	22-08-1991 29-10-1991 14-12-1995 21-08-1991 08-05-2000 03-08-1992
EP 0008540	A	05-03-1980	US 4386086 A AT 9958 T DE 2967276 D1 EP 0008540 A2 FI 792574 A IE 49619 B1	31-05-1983 15-11-1984 29-11-1984 05-03-1980 25-02-1980 13-11-1985
US 4351666	A	28-09-1982	NONE	
WO 9620196	A	04-07-1996	DE 19540736 A1 AU 4342096 A BR 9510256 A CA 2208375 A1 CN 1175257 A ,B DE 59510597 D1 WO 9620196 A1 EP 0799228 A1 HU 77880 A2 JP 10511366 T PL 322741 A1 US 6051723 A US 5830825 A ZA 9510888 A	27-06-1996 19-07-1996 04-11-1997 04-07-1996 04-03-1998 24-04-2003 04-07-1996 08-10-1997 28-09-1998 04-11-1998 16-02-1998 18-04-2000 03-11-1998 24-06-1996
WO 0078881	A	28-12-2000	AU 5682100 A BR 0011702 A CN 1355806 T WO 0078881 A2 EP 1183317 A2 HU 0201492 A2 JP 2003503317 T	09-01-2001 26-03-2002 26-06-2002 28-12-2000 06-03-2002 28-08-2002 28-01-2003

フロントページの続き

(51) Int.Cl. ⁷	F I	テーマコード (参考)
A 0 1 N 43/90	A 0 1 N 25/12	
	A 0 1 N 25/14	
	A 0 1 N 43/90	1 0 3

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

(72) 発明者 フリードマン, エイドリアン アルベルト
イギリス国, バークシャー アールジー 4 2 6 イーワイ, ブラックネル, ジーロツツ ヒル インターナショナル リサーチ センター, シンジエンタ リミティド

(72) 発明者 ストレル, アンドレ
スイス国, ツェーハー - 4 0 5 8 バーゼル, シュバルツバルトアレー 2 1 5, シンジエンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト

(72) 発明者 ベンデボルン, セバスティアン
スイス国, ツェーハー - 4 0 5 8 バーゼル, シュバルツバルトアレー 2 1 5, シンジエンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト

F ターム (参考) 4C072 AA01 BB02 CC02 CC11 EE09 FF04 GG07 HH02 UU02
4H011 AB01 AB03 BA01 BA03 BA06 BB10 BC03 BC05 BC07 BC09
BC18 BC19 BC20 DA02 DA15 DA16 DH03 DH10