

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第6063923号
(P6063923)

(45) 発行日 平成29年1月18日 (2017. 1. 18)

(24) 登録日 平成28年12月22日 (2016. 12. 22)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 237/14 (2006. 01)

C O 7 D 237/14 C S P

C O 7 D 401/04 (2006. 01)

C O 7 D 401/04

A O 1 N 43/58 (2006. 01)

A O 1 N 43/58

C

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

A O 1 P 13/00

請求項の数 9 (全 22 頁)

(21) 出願番号 特願2014-503131 (P2014-503131)
 (86) (22) 出願日 平成24年4月4日 (2012. 4. 4)
 (65) 公表番号 特表2014-511854 (P2014-511854A)
 (43) 公表日 平成26年5月19日 (2014. 5. 19)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2012/056162
 (87) 国際公開番号 W02012/136703
 (87) 国際公開日 平成24年10月11日 (2012. 10. 11)
 審査請求日 平成27年4月3日 (2015. 4. 3)
 (31) 優先権主張番号 1106062. 1
 (32) 優先日 平成23年4月8日 (2011. 4. 8)
 (33) 優先権主張国 英国 (GB)

(73) 特許権者 500371307
 シンジェンタ リミテッド
 イギリス国 サリー ジーユー2 7ワイ
 エイチ, ギルドフォード, サリー リサー
 チ パーク, プリーストリー ロード, ユ
 アロピーアン リージョナル センター
 (74) 代理人 100086771
 弁理士 西島 孝喜
 (74) 代理人 100088694
 弁理士 弟子丸 健
 (74) 代理人 100094569
 弁理士 田中 伸一郎
 (74) 代理人 100084663
 弁理士 箱田 篤

最終頁に続く

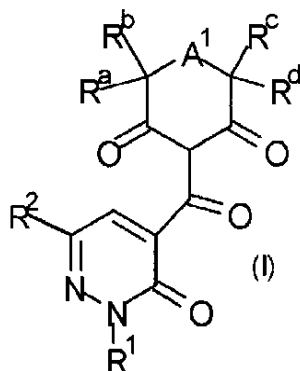
(54) 【発明の名称】 除草性化合物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



10

[式中、

R¹ は、水素と、C₁ ~ C₆アルキルと、C₁ ~ C₆ハロアルキルと、C₁ ~ C₃アルコキシ -

20

$C_1 \sim C_3$ アルキルと、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ アルキルと、
 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルと、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルと、 $C_4 \sim C_6$ - オキサ置換シクロアルコキシ - $C_1 \sim C_3$ - アルキルと、 $C_4 \sim C_6$ - オキサ置換シクロアルキル - $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ - アルキルと、 $C_4 \sim C_6$ - オキサ置換シクロアルコキシ - $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキルと、 $C_4 \sim C_6$ - オキサ置換シクロアルキル - $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキルと、($C_1 \sim C_3$ アルカンシルホニル - $C_1 \sim C_3$ アルキルアミノ) - $C_1 \sim C_3$ アルキルと、($C_1 \sim C_3$ アルカンシルホニル - $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルアミノ) - $C_1 \sim C_3$ アルキルと、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル - $C_1 \sim C_3$ アルキルと、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル - $C_2 \sim C_6$ アルケニルと、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルと、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルと、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルと、シアノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキルと、アリールカルボニル - $C_1 \sim C_3$ - アルキル(ただし、前記アリールは任意選択でハロ、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキルからなる群の中の1個または複数個の置換基で置換されてもよい)と、アリール - $C_1 \sim C_6$ アルキルと、アリールオキシ - $C_1 \sim C_6$ アルキル(ただし、両方のケースにおいて前記アリールは任意選択でハロ、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキルからなる群の中の1個または複数個の置換基で置換されてもよい)と、芳香族でも飽和でも部分飽和でもよく、かつそれぞれ独立して窒素、酸素、および硫黄からなる群から選択される1~4個のヘテロ原子を含有することができる3~10員単環または二環系であって、前記環系が、任意選択で $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルケニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキニル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル - S(O)p - 、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル - S(O)p - 、アリール、アリール - S(O)p、ヘテロアリール - S(O)p、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルアミノ - S(O)p - 、 $C_1 \sim C_3$ アルキルアミノ - S(O)p - $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ジアルキルアミノ - S(O)p - 、 $C_1 \sim C_3$ ジアルキルアミノ - S(O)p - $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルアミノカルボニル - 、 $C_1 \sim C_3$ アルキルアミノカルボニル - $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_3$ ジアルキルアミノカルボニル - $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル - S(O)p - アミノ、シアノ、およびニトロからなる群から選択される1個または複数個の置換基によって置換され、前記ヘテロアリール置換基が、酸素、窒素、および硫黄からなる群からそれぞれ独立して選択される1~3個のヘテロ原子を含有し、かつ前記アリールまたはヘテロアリール成分が、任意選択でハロ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、フェニル、シアノ、およびニトロからなる群から選択される1個または複数個の置換基によって置換されてもよい、3~10員単環または二環系とからなる群から選択され、

R^2 は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル - S(O)p - 、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル - S(O)p - からなる群から選択され、

$p = 0, 1$ 、または2、

A^1 は、O、C(O)、および(CR^eR^f)からなる群から選択され、

R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e および R^f は、それぞれ独立して水素および $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群から選択され、 R^a および R^c は一緒になって $C_1 \sim C_3$ アルキレン鎖を形成してもよい]

の除草性化合物または前記化合物の農学的に許容できる塩。

【請求項2】

R^1 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ - $C_2 \sim C_3$ アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、

アリール、5員または6員ヘテロアリール、5員または6員ヘテロアリール - $C_1 \sim C_3$ アルキル、およびヘテロシクリル - $C_1 \sim C_3$ アルキルからなる群から選択され、前記ヘテロアリールまたはヘテロシクリルが、それぞれ独立して酸素、窒素、および硫黄からなる群から選択される1個～3個のヘテロ原子を含有し、かつ前記アリール、ヘテロシクリル、またはヘテロアリール成分が、任意選択でハロ、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ、シアノ、およびニトロからなる群から選択される1個または複数個の置換基で置換されてもよい、請求項1に記載の除草性化合物。

【請求項3】

R^1 が、アリール、5員または6員ヘテロアリール、および5員または6員ヘテロアリール - $C_1 \sim C_3$ アルキルからなる群から選択され、前記ヘテロアリールが、それぞれ独立して酸素、窒素、および硫黄からなる群から選択される1個～3個のヘテロ原子を含有し、かつ前記アリールまたはヘテロアリール成分が、任意選択でハロ、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ、シアノ、およびニトロからなる群から選択される1個または複数個の置換基で置換されてもよい、請求項1又は2に記載の除草性化合物。

10

【請求項4】

R^2 が水素またはメチルである、請求項1～3のいずれか一項に記載の除草性化合物。

【請求項5】

請求項1～4のいずれか一項に記載の除草性化合物と、農学的に許容できる製剤補助剤とを含む、除草剤組成物。

20

【請求項6】

少なくとも1種類の追加の農薬をさらに含む、請求項5に記載の除草剤組成物。

【請求項7】

前記追加の農薬が、除草剤または除草剤毒性緩和剤である、請求項6に記載の除草剤組成物。

【請求項8】

現場に請求項5～7のいずれか一項に記載の組成物の雑草駆除量を散布することを含む、前記現場で雑草を駆除する方法。

【請求項9】

請求項1に記載の式(I)の化合物の除草剤としての使用。

30

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規な除草性ピリダジノン誘導体、それらの調製方法、それら除草性化合物を含む組成物、および雑草、具体的には有用な植物の農作物中の雑草を駆除するための、または植物の成長を抑制するためにそれらを使用することに関する。

【背景技術】

【0002】

除草性ピリジン誘導体は、例えば欧州特許第1982978号明細書から知られ、ピリミドン誘導体は、国際公開第2011/031658号パンフレットから知られる。

40

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

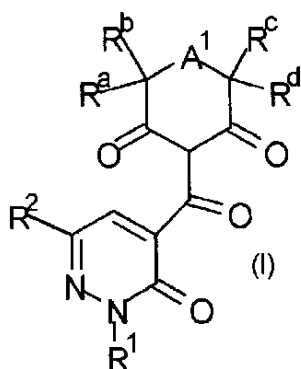
【0003】

今回、ピリダジノン誘導体が有利な除草特性を示すことを発見した。

【0004】

すなわち、本発明によれば式(I)

【化 1】



10

[式中、

R^1 は、水素と、 $C_1 \sim C_6$ アルキルと、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルと、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ アルキルと、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ アルキルと、
 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルと、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルと、 $C_4 \sim C_6$ - オキサ置換シクロアルコキシ - $C_1 \sim C_3$ - アル
 キルと、 $C_4 \sim C_6$ - オキサ置換シクロアルキル - $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ - アル
 キルと、 $C_4 \sim C_6$ - オキサ置換シクロアルコキシ - $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキルと、 $C_4 \sim C_6$
 - オキサ置換シクロアルキル - $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキルと、($C_1 \sim C_3$ アルカンスルホニル - $C_1 \sim C_3$ アルキルアミノ) - $C_1 \sim C_3$ アルキルと、($C_1 \sim C_3$
 アルカンスルホニル - $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルアミノ) - $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$
 アルキルカルボニル - $C_1 \sim C_3$ アルキルと、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル - $C_2 \sim C_6$ アルケ
 ニルと、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルと、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルと、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルと、シ
 アノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキルと、アリールカルボニル - $C_1 \sim C_3$ - アルキル(ただし、この
 アリールは任意選択でハロ、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - ハ
 ロアルキルからなる群の中の 1 個または複数個の置換基で置換されてもよい)と、アリール
 - $C_1 \sim C_6$ アルキルと、アリールオキシ - $C_1 \sim C_6$ アルキル(ただし、これら両方のケ
 ースにおいてそのアリールは任意選択でハロ、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ - アルキ
 ル、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキルからなる群の中の 1 個または複数個の置換基で置換されても
 よい)と、芳香族でも飽和でも部分飽和でもよく、かつそれぞれ独立して窒素、酸素、お
 よび硫黄からなる群から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含有することができる 3 ~ 1
 0 員単環または二環系(この環系は、任意選択で $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキ
 ル、 $C_1 \sim C_3$ アルケニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキニル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアル
 コキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル - $S(O)p$ - 、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル - $S(O)p$ - 、アリ
 ール、アリール - $S(O)p$ 、ヘテロアリール - $S(O)p$ 、アリールオキシ、ヘテロア
 リールオキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルアミノ - $S(O)p$ -
 、 $C_1 \sim C_3$ アルキルアミノ - $S(O)p$ - $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ジアルキルアミノ
 - $S(O)p$ - 、 $C_1 \sim C_3$ ジアルキルアミノ - $S(O)p$ - $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$
 アルキルアミノカルボニル - 、 $C_1 \sim C_3$ アルキルアミノカルボニル - $C_1 \sim C_3$ アルキル、
 $C_1 \sim C_3$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_3$ ジアルキルアミノカルボニル - $C_1 \sim C_3$
 アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル - $S(O)p$ - アミノ
 、シアノ、およびニトロからなる群から選択される 1 個または複数個の置換基によって置
 換され、このヘテロアリール置換基は、酸素、窒素、および硫黄からなる群からそれぞれ
 独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含有し、かつこのアリールまたはヘテロアリ
 ール成分は、任意選択でハロ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アル
 コキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、フェニル、シアノ、およびニトロからなる群から選択
 される 1 個または複数個の置換基によって置換されてもよい)とからなる群から選択され

20

30

40

50

、
 R^2 は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル - $S(O)_p$ - 、および $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル - $S(O)_p$ - からなる群から選択され、

$p = 0, 1$ 、または 2 、

A^1 は、 O 、 $C(O)$ 、および (CR^eR^f) からなる群から選択され、

R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e および R^f は、それぞれ独立して水素および $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群から選択され、 R^a および R^c は一緒になって $C_1 \sim C_3$ アルキレン鎖を形成してもよい]

10

の除草性化合物または前記化合物の農学的に許容できる塩が提供される。

【0005】

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素、またはヨウ素を包含する。同様のことが他の定義の文脈中のハロゲン、例えばハロアルキルまたはハロフェニルにも適用される。

【0006】

1 ~ 6 個の炭素原子の鎖長を有す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、ヘプタフルオロ - n - プロピル、およびペルフルオロ - n - ヘキシルである。

20

【0007】

好適なアルキレニルラジカルには、例えば CH_2 、 $CHCH_3$ 、 $C(CH_3)_2$ 、 CH_2CHCH_3 、および $CH_2CH(C_2H_5)$ が挙げられる。

【0008】

好適なハロアルケニルラジカルには、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る）によって 1 回または複数回置換されたアルケニル基、例えば 2, 2 - ジフロロ - 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 - ブロモプロペニル、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 - トリフルオロブタ - 2 - エン - 1 - イルが挙げられる。ハロゲンによって 1 回、2 回、または 3 回置換された好ましい $C_2 \sim C_6$ アルケニルラジカルは、2 ~ 5 個の炭素原子の鎖長を有するものである。好適なハロアルキルアルキニルラジカルには、例えばハロゲン（ハロゲンは臭素またはヨウ素、特にフッ素または塩素である）によって 1 回または複数回置換されたアルキルアルキニル基、例えば 3 - フルオロプロピニル、5 - クロロペンタ - 2 - イン - 1 - イル、5 - ブロモペンタ - 2 - イン - 1 - イル、3, 3, 3 - トリフロロプロピニル、および 4, 4, 4 - トリフロロ - ブタ - 2 - イン - 1 - イルが挙げられる。ハロゲンによって 1 回または複数回置換された好ましいアルキルアルキニル基は、3 ~ 5 個の炭素原子の鎖長を有するものである。

30

【0009】

アルコキシ基は、好ましくは 1 ~ 6 個の炭素原子の鎖長を有する。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 - ブトキシまたは $tert$ - ブトキシ、あるいはペンチルオキシまたはヘキシルオキシ異性体、好ましくはメトキシおよびエトキシである。アルキルカルボニルは、好ましくはアセチルまたはプロピオニル、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、好ましくはメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、または $tert$ - ブトキシカルボニルである。

40

【0010】

50

ハロアルコキシは、例えばフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ、2 - フルオロエトキシ、2 - クロロエトキシ、2, 2 - ジフルオロエトキシ、または2, 2, 2 - トリクロロエトキシ、好ましくはジフルオロメトキシ、2 - クロロエトキシ、またはトリフルオロメトキシである。

【0011】

アルキルチオ基は、好ましくは1個～6個の炭素原子の鎖長を有する。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、好ましくはメチルチオまたはエチルチオである。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、好ましくはメチルスルフィニルまたはエチルスルフィニルである。

10

【0012】

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、好ましくはメチルスルホニルまたはエチルスルホニルである。

【0013】

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、またはジイソプロピルアミノである。1個～4個の炭素原子の鎖長を有するアルキルアミノ基が優先される。

20

【0014】

シクロアルキルアミノまたはジシクロアルキルアミノは、例えばシクロヘキシルアミノまたはジシクロプロピルアミノである。

【0015】

アルコキシアルキル基は、好ましくは1個～6個の炭素原子を有する。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。

30

【0016】

アルキルチオアルキル基は、好ましくは1個～6個の炭素原子を有する。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。

【0017】

3～10員単環または二環系は、芳香族でも飽和でも部分飽和でもよく、かつそれぞれ独立して窒素、酸素、および硫黄からなる群から選択される1～4個のヘテロ原子を含有することができ、この環系は、任意選択でC₁～C₃アルキル、C₁～C₃ハロアルキル、C₁～C₃アルケニル、C₁～C₃アルキニル、C₁～C₃アルコキシ、C₁～C₃ハロアルコキシ、C₁～C₆アルキル - S(O)p - 、C₁～C₆ハロアルキル - S(O)p - 、アリール、アリール - S(O)p、ヘテロアリール - S(O)p、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、C₁～C₃アルコキシカルボニル、C₁～C₃アルキルアミノ - S(O)p - 、C₁～C₃アルキルアミノ - S(O)p - C₁～C₃アルキル、C₁～C₃ジアルキルアミノ - S(O)p - 、C₁～C₃ジアルキルアミノ - S(O)p - C₁～C₃アルキル、C₁～C₃アルキルアミノカルボニル - 、C₁～C₃アルキルアミノカルボニル - C₁～C₃アルキル、C₁～C₃ジアルキルアミノカルボニル、C₁～C₃ジアルキルアミノカルボニル - C₁～C₃ア

40

50

ルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル-S(O)p-アミノ、シアノ、およびニトロからなる群から独立して選択される1個または複数個の置換基によって置換される。したがって、このような環系には、例えばシクロアルキル、フェニル、ヘテロシクリル、およびヘテロアリールが含まれる。「部分飽和した」環の例には、例えば1,4ベンゾジオキシンおよび1,3ベンゾジオキソールが挙げられる。

【0018】

シクロアルキル基は、好ましくは3環~6環炭素原子を有し、1個または複数個のメチル基によって置換されてもよい。それらは好ましくは非置換であり、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、またはシクロヘキシルである。

【0019】

アリールには、ベンジルと、フェニルとが挙げられ、フェニルにはフェノキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、ベンゾイル、フェニルチオ、フェニルアルキル、フェノキシアルキル、またはトシルなどの置換基の部分としてのフェニルが含まれ、それは一置換形態または多置換形態であることができ、その場合、それら置換基は必要に応じオルト、メタ、および/またはパラ位であることができる。

【0020】

ヘテロシクリルには、例えばモルホリニル、テトラヒドロフリルが挙げられる。

【0021】

ヘテロアリールオキシなどの置換基の部分としてのヘテロアリールを含めたヘテロアリールは、例えばそれぞれが独立して酸素、窒素、および硫黄からなる群から選択される1個~3個のヘテロ原子を含有する5員または6員ヘテロアリールを意味する。このヘテロアリール成分は任意選択で一置換されてもまた多置換されてもよいことを理解されたい。したがって用語ヘテロアリールには、例えばフラニル、チオフェニル、チアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、ピラゾリル、イソチアゾリル、ピリジリル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリミジニル、およびトリアゾリルが含まれる。

【0022】

式Iの化合物は不斉中心を含むことができ、また単一鏡像異性体として、任意の割合の鏡像異性体の対として存在することができ、あるいは2個以上の不斉中心が存在する場合はジアステレオ異性体をあらゆる可能性のある比率で含有することができる。一般に鏡像異性体の一方は、もう一方の可能性と比べて高い生物学的活性を有する。

【0023】

同様に、二置換アルケンが存在する場合、それらはE形またはZ形で、あるいは任意の割合の両方の混合物として存在することができる。

【0024】

さらに式Iの化合物は、代替的なヒドロキシル互換異性型と平衡状態にあってもよい。すべての互換異性型(単一互換異性体またはその混合物)、ラセミ混合物、および単一異性体が発明の範囲内に包含されることを理解されたい。

【発明を実施するための形態】

【0025】

一実施形態では R^1 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ $C_2 \sim C_3$ アルコキシ $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、および $C_1 \sim C_3$ アルコキシ- $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルからなる群から選択される。

【0026】

別の好ましい実施形態では R^1 は、アリール、好ましくはフェニル、あるいはそれぞれ独立して酸素、窒素、および硫黄からなる群から選択される1個~3個のヘテロ原子を含有する5員または6員ヘテロアリールであり、このアリールまたはヘテロアリールは、任意選択でハロ、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル-S(O)p-、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル-S(O)p-、シアノ、およびニトロからなる群から選択される1個または複数個の置換

10

20

30

40

50

基で置換されてもよい。特に好ましくは、 R^1 は任意選択でフェニル、フェノキシ、フェノキシ- $C_1 \sim C_6$ アルキル、ベンジル、チオフェニル、1,4-ベンゾジオキシニル、1,3-ベンゾジオキシニル(1,3-benzodioxolyl)、およびピリジルからなる群から選択され、最も好ましくは任意選択で置換されたフェニルまたはピリジルである。

【0027】

別の好ましい実施形態では R^2 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル(好ましくはメチル)、ハロゲン(好ましくは塩素)、 $C_2 \sim C_6$ -アルコキシ(好ましくはメトキシ)、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル(好ましくは CF_3)、およびCNからなる群から選択される。より好ましい実施形態では R^2 は、メチルの水素である。

10

【0028】

別の実施形態では A^1 が CR^eR^f であり、また R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e および R^f が水素である。本発明の別の実施形態では A^1 が CR^eR^f であり、 R^b 、 R^d 、 R^e および R^f が水素であり、 R^a および R^c が一緒になってエチレン鎖を形成する。

【0029】

本発明はまた、式Iの化合物がアミン(例えば、アンモニア、ジメチルアミン、およびトリエチルアミン)、アルカリ金属およびアルカリ土類金属の塩基、または第四アンモニウム塩基と共に形成することができる農学的に許容できる塩を含む。塩形成剤として使用されるアルカリ金属およびアルカリ土類金属の水酸化物、酸化物、アルコキシド、および炭酸水素塩および炭酸塩のなかでは、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、アルコキシド、酸化物、および炭酸塩が重要視されることになるが、特にナトリウム、マグネシウム、およびカルシウムのものである。その対応するトリメチルスルホニウム塩もまた使用することができる。

20

【0030】

本発明による式Iの化合物はそれらだけで除草剤として使用することもできるが、それらは一般にはキャリア、溶媒、および界面活性剤(SFA)などの製剤補助剤を用いて除草組成物に製剤化される。したがって本発明はさらに、前の特許請求の範囲のいずれか一項に記載の除草性化合物と、農学的に許容される製剤補助剤とを含む除草組成物を提供する。この組成物は、使用の前に希釈される濃縮物の形態であることができるが、そのまま使える組成物もまた製造することができる。最終希釈は一般には水で行うが、水の代わりにまたはそれに加えて、例えば液肥、微量栄養素、生物、油、または溶剤で行うこともできる。

30

【0031】

これら除草組成物は、一般には式Iの化合物を0.1~99重量%、とりわけ0.1~95重量%と、製剤補助剤を1~99.9重量%含み、製剤補助剤は、好ましくは界面活性物質を0~25重量%含む。

【0032】

この組成物は複数種の製剤の型から選択することができ、その多くはManual on Development and Use of FAO Specifications for Plant Protection Products, 第5版, 1999年から知られる。それらには、散粉性粉末剤(DP)、可溶性粉剤(SP)、水溶性顆粒剤(SG)、顆粒水和剤(WG)、水和剤(WP)、粒剤(GR)(緩効性または速放性)、可溶性濃厚剤(SL)、油混和性液剤(OL)、微量散布用液剤(UL)、乳剤(EC)、分散性濃厚剤(DC)、エマルジョン剤(水中油型(EW)および油中水型(EO)の両方)マイクロエマルジョン剤(ME)、懸濁製剤(SC)、エアロゾル、カプセル懸濁液剤(CS)、および種子処理製剤が挙げられる。いかなる場合でも選択される製剤の型は、想定される特定の目的と、その式(I)の化合物の物理的、化学的、および生物学的特性とによって決まることになる。

40

【0033】

散粉性粉末剤(DP)は、式(I)の化合物を、1種類または複数種類の固体希釈剤(

50

例えば、天然クレー、カオリン、葉蠟石、ベントナイト、アルミナ、モンモリロナイト、多孔質珪藻土、胡粉、珪藻土、リン酸カルシウム、炭酸カルシウムおよび炭酸マグネシウム、硫黄、石灰、穀粉、タルク、および他の有機および無機固体キャリア）と混合し、その混合物を機械的に粉碎して細粉にすることによって調製することができる。

【 0 0 3 4 】

可溶性粉剤（SP）は、式（I）の化合物を、1種類または複数種類の水溶性無機塩（重炭酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、または硫酸マグネシウムなど）あるいは1種類または複数種類の水溶性有機固体（多糖など）、および任意選択で水分散性／溶解性を向上させるための1種類または複数種類の湿潤剤、1種類または複数種類の分散剤、または上記薬品の混合物と混合することによって調製することができる。次いでこの混合物を粉碎して細粉にする。また同様の組成物を造粒して水溶性顆粒剤（SG）を形成することができる。

10

【 0 0 3 5 】

水和剤（WP）は、式（I）の化合物を、1種類または複数種類の固体希釈剤またはキャリア、1種類または複数種類の湿潤剤、および好ましくは1種類または複数種類の分散剤、および任意選択で液体中での分散を容易にするための1種類または複数種類の懸濁化剤と混合することによって調製することができる。また同様の組成物を造粒して顆粒水和剤（WG）を形成することができる。

【 0 0 3 6 】

粒剤（GR）は、式（I）の化合物と1種類または複数種類の粉末状固体希釈剤またはキャリアの混合物を造粒するか、または式（I）の化合物（または適切な薬品に溶かしたその溶液）を多孔質粒状材料（軽石、アタパルジャイトクレー、フラー土、多孔質珪藻土、珪藻土、または粉碎トウモロコシ穂軸など）中に吸収することによる予成形したブランク顆粒から造粒することによって、あるいは式（I）の化合物（または適切な薬品に溶かしたその溶液）を硬質のコア材（砂、ケイ酸塩、鉱物炭酸塩、硫酸塩、またはリン酸塩など）上に吸着させ、必要ならば乾燥することによって形成することができる。吸収または吸着を助けるために一般に使用される薬品には、溶媒（脂肪族および芳香族石油溶媒、アルコール、エーテル、ケトン、およびエステルなど）および固着剤（ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、デキストリン、糖、および植物油）が挙げられる。1種類または複数種類の他の添加剤（例えば、乳化剤、湿潤剤、または分散剤）もまた、顆粒中に含めることができる。

20

30

【 0 0 3 7 】

分散性濃厚剤（DC）は、式（I）の化合物を、水または有機溶媒、例えばケトン、アルコール、またはグリコールエーテル中に溶解することによって調製することができる。これらの溶液は界面活性剤を含有してもよい（例えば、水による希釈を改善するために、または噴霧タンク中での結晶化を防止するために）。

【 0 0 3 8 】

乳剤（EC）または水中油型エマルジョン剤（EW）は、式（I）の化合物を有機溶媒（任意選択で、1種類または複数種類の湿潤剤、1種類または複数種類の乳化剤、または上記薬品の混合物を含有する）中に溶解することによって調製することができる。ECで使用する好適な有機溶媒には、芳香族炭化水素（例えば、アルキルベンゼンまたはアルキルナフタレン、例としてはSOLVESSO 100、SOLVESSO 150、SOLVESSO 200（SOLVESSOは登録商標である））、ケトン（例えば、シクロヘキサノンまたはメチルシクロヘキサノン）およびアルコール（例えば、ベンジルアルコール、フルフリルアルコール、またはブタノール）、N-アルキルピロリドン（例えば、N-メチルピロリドンまたはN-オクチルピロリドン）、脂肪酸のジメチルアミド（例えば、C₈~C₁₀脂肪酸ジメチルアミド）、および塩素化炭化水素が挙げられる。EC製品は、水に加えると自然に乳化して、適切な設備による噴霧散布を可能にするのに十分な安定性を有するエマルジョンを生成することができる。

40

【 0 0 3 9 】

50

EWの調製は、液体として（それが室温で液体でない場合にはそれを妥当な温度、一般には70 未満で溶融してもよい）、または溶液の状態で（それを適切な溶媒中に溶解することにより）式（I）の化合物を得ること、次いで得られた液体または溶液を、高せん断下で1種類または複数種類のSFAを含有する水中に乳化してエマルションを生成させることを伴う。EWで使用する好適な溶媒には、植物油、塩素化炭化水素（クロロベンゼンなど）、芳香族溶媒（アルキルベンゼンまたはアルキルナフタレンなど）、および水中の溶解度が低い他の適切な有機溶媒が挙げられる。

【0040】

マイクロエマルション剤（ME）は、1種類または複数種類の溶媒と1種類または複数種類のSFAのブレンド物を水と混合して、熱力学的に安定な等方性液体製剤を自然に生成させることによって調製することができる。式（I）の化合物は、最初にその水中または溶媒/SFAブレンド物中のいずれかに存在する。MEで使用する好適な溶媒には、ECでまたはEWで使用するために以前に述べたものが挙げられる。MEは、水中油系または油中水系のどちらでもよく（どちらの系が存在するかは導電率の測定によって決めることができる）、これは同一製剤中に水溶性と油溶性の農薬を混ぜ合わせるのに適している場合がある。MEは、マイクロエマルションとして残したまま、または従来の水中油型エマルションを形成して水に希釈するのに適している。

【0041】

懸濁剤（SC）は、式（I）の化合物の細かく分割した不溶性固体粒子の水性または非水性懸濁液を含むことができる。SCは、適切な媒体中の式（I）の固体化合物を、任意選択で1種類または複数種類の分散剤と共にボールまたはビーズミル粉碎して化合物の微粒子懸濁液を生成することによって調製することができる。その組成物中には1種類または複数種類の湿潤剤が含まれてもよく、また粒子が沈降する速度を減ずるために懸濁化剤が含まれてもよい。別法では、式（I）の化合物を乾式粉碎し、それを以前に述べた薬品を含有する水に加えて、所望の最終製品を生成することもできる。

【0042】

エアゾル製剤は、式（I）の化合物および適切な噴射剤（例えばn-ブタン）を含む。式（I）の化合物はまた、適切な媒体（例えば、水または水混和性液体、例えばn-プロパノール）中に溶解または分散して、非加圧式の手動噴霧ポンプに使用する組成物を得ることもできる。

【0043】

カプセル懸濁液剤（CS）は、EW製剤の調製とよく似ているが、油滴の水性分散液が得られるような追加の重合段階を伴う方法で調製することができる。その場合、各油滴は高分子シェルによってカプセル封入され、式（I）の化合物と、任意選択でそのためのキャリアまたは希釈剤とを含有する。高分子シェルは、界面重縮合反応またはコアセルベーション手順のいずれかによって生成することができる。これら組成物は式（I）の化合物の制御放出を実現することができ、またそれらは種子処理のために使用することができる。式（I）の化合物はまた、生分解性高分子マトリックス中で製剤化して、その化合物の遅効性制御放出を実現することもできる。

【0044】

組成物は、例えば表面の濡れ、保持力、または分布、あるいは処理表面の耐雨性、あるいは式（I）の化合物の取込みまたは可動性を改善することによってその組成物の生物学的性能を向上させる1種類または複数種類の添加剤を含んでもよい。このような添加剤には、界面活性剤（SFA）、油から作られる噴霧添加剤、例えばある種の鉱油または天然植物油（ダイズ油およびナタネ油など）、およびこれらと他の生物増進（bio-enhancing）補助剤（式（I）の化合物の作用を助けまたは改変することができる成分）のブレンド物が挙げられる。

【0045】

湿潤剤、分散剤、および乳化剤は、陽イオン、陰イオン、両性イオン、または非イオン型のSFAであることができる。

10

20

30

40

50

【 0 0 4 6 】

陽イオン型の好適な S F A には、第四アンモニウム化合物（例えば、臭化セチルトリメチルアンモニウム）、イミダゾリン、およびアミン塩が挙げられる。

【 0 0 4 7 】

好適な陰イオン S F A には、脂肪酸のアルカリ金属塩、硫酸の脂肪族モノエステルの塩（例えば、ラウリル硫酸ナトリウム）、スルホン化芳香族化合物の塩（例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム、スルホン酸ブチルナフタレン、およびジ - イソプロピルナフタレンスルホン酸ナトリウムとトリ - イソプロピルナフタレンスルホン酸ナトリウムの混合物）、硫酸エーテル、硫酸アルコールエーテル（例えば、ラウレス - 3 - 硫酸ナトリウム）、カルボン酸エーテル（例えば、ラウレス - 3 - カルボン酸ナトリウム）、リン酸エステル（１種類または複数種類の脂肪アルコールとリン酸の反応による生成物（主にモノエステル）またはそれと五酸化リンの反応による生成物（主にジエステル）、例えばラウリルアルコールと四リン酸の反応による生成物、さらにこれらの生成物はエトキシ化されてもよい）、スルホコハク酸塩（sulfosuccinamate）、パラフィンまたはオレフィンスルホン酸塩、タウレート、およびリグノスルホン酸塩が挙げられる。

【 0 0 4 8 】

好適な両性型の S F A には、ベタイン、プロピオナート、およびグリシナートが挙げられる。

【 0 0 4 9 】

好適な非イオン型の S F A には、アルキレンオキシド、例えばエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシド、またはこれらの混合物と、脂肪アルコール（オレイルアルコールまたはセチルアルコールなど）またはアルキルフェノール（オクチルフェノール、ノニルフェノール、またはオクチルクレゾールなど）の縮合生成物、長鎖脂肪酸または無水ヘキシトールから誘導される部分エステル、上記部分エステルとエチレンオキシドの縮合生成物、ブロックポリマー（エチレンオキシドおよびプロピレンオキシドを含む）、アルカノールアミド、単純なエステル（例えば、脂肪酸ポリエチレングリコールエステル）、アミノオキシド（例えば、ラウリルジメチルアミノオキシド）、およびレシチンが挙げられる。

【 0 0 5 0 】

好適な懸濁化剤には、親水コロイド（多糖、ポリビニルピロリドン、またはナトリウムカルボキシメチルセルロースなど）および膨潤クレー（ベントナイトまたはアタパルジャイト）が挙げられる。

【 0 0 5 1 】

本発明の組成物はさらに、少なくとも１種類の追加の農薬を含むことができる。例えば、本発明による化合物はまた、他の除草剤または植物成長調整剤と併用することができる。好ましい実施形態では追加の農薬は、除草剤および／または除草剤毒性緩和剤である。このような混合物の例は下記のとおりである（ただし「I」は、式Iの化合物を表す）。
I + アセトクロール、I + アシフルオルフェン、I + アシフルオルフェン - ナトリウム、I + アクロニフェン、I + アクロレイン、I + アラクロール、I + アロキシジム、I + アメトリン、I + アミカルバゾン、I + アミドスルフロン、I + アミノピラリド、I + アミトロール、I + アニロホス、I + アシュラム、I + アトラジン、I + アザフェニジン、I + アジメスルフロン、I + B C P C、I + ベフルブタミド、I + ベナゾリン、I + ベンカルバゾン、I + ベンフルラリン、I + ベンフレセート、I + ベンスルフロン、I + ベンスルフロン - メチル、I + ベンスリド、I + ベンタゾン、I + ベンズフェンジゾン、I + ベンゾビシクロン、I + ベンゾフェナップ、I + ビシクロピロン、I + ビフェノックス、I + ピラナホス、I + ビスピリバック、I + ビスピリバック - ナトリウム、I + ホウ砂、I + プロマシル、I + プロモブチド、I + プロモキシニル、I + ブタクロール、I + ブタミホス、I + ブトラリン、I + ブトロキシジム、I + ブチレート、I + カコジル酸、I + 塩素酸カルシウム、I + カフェンストロール、I + カルベタミド、I + カルフェントラゾン

、 I + カルフェントラゾン - エチル、 I + クロルフルレノール、 I + クロルフルレノール - メチル、 I + クロリダゾン、 I + クロリムロン、 I + クロリムロン - エチル、 I + クロロ酢酸、 I + クロロトルロン、 I + クロルプロファミン、 I + クロルスルフロン、 I + クロルタール、 I + クロルタール - ジメチル、 I + シニドン - エチル、 I + シンメチリン、 I + シノスルフロン、 I + シスアニリド、 I + クレトジム、 I + クロジナホップ、 I + クロジナホップ - プロパルギル、 I + クロマゾン、 I + クロメプロップ、 I + クロピラリド、 I + クロランスラム、 I + クロランスラム - メチル、 I + シアナジン、 I + シクロエート、 I + シクロスルファミン、 I + シクロキシジム、 I + シハロホップ、 I + シハロホップ - ブチル、 I + 2, 4 - D、 I + ダイムロン、 I + ダラポン、 I + ダゾメット、 I + 2, 4 - DB、 I + デスメジファミン、 I + ジカンバ、 I + ジクロベニル、 I + ジクロルプロップ、 I + ジクロルプロップ - P、 I + ジクロホップ、 I + ジクロホップ - メチル、 I + ジクロスラム、 I + ジフェンゾクワット、 I + ジフェンゾクワットメチル硫酸塩、 I + ジフルフェニカン、 I + ジフルフェンゾピル、 I + ジメフロン、 I + ジメピペレート、 I + ジメタクロル、 I + ジメタメトリン、 I + ジメテナミド、 I + ジメテナミド - P、 I + ジメチピン、 I + ジメチルアルシン酸、 I + ジニトラミン、 I + ジノテルブ、 I + ジフェナミド、 I + ジプロペトリン、 I + ジクワット、 I + 二臭化ジクワット、 I + ジチオピル、 I + ジウロン、 I + エンドタール、 I + E P T C、 I + エスプロカルブ、 I + エタルフルラリン、 I + エタメツルフロン、 I + エタメツルフロン - メチル、 I + エセフォン、 I + エトフメセート、 I + エトキシフェン、 I + エトキシスルフロン、 I + エトベンザニド、 I + フェノキサプロップ - P、 I + フェノキサプロップ - P - エチル、 I + フェントラザミド、 I + 硫酸鉄 (I I)、 I + フラムプロップ - M、 I + フラザスルフロン、 I + フロラスラム、 I + フルアジホップ、 I + フルアジホップ - ブチル、 I + フルアジホップ - P、 I + フルアジホップ - P - ブチル、 I + フルアゾラート、 I + フルカルバゾン、 I + フルカルバゾン - ナトリウム、 I + フルセトスルフロン、 I + フルクロラリン、 I + フルフェナセツ、 I + フルフェンピル、 I + フルフェンピル - エチル、 I + フルメトラリン、 I + フルメツラム、 I + フルミクロラック、 I + フルミクロラック - ペンチル、 I + フルミオキサジン、 I + フルミプロピン、 I + フルオメツロン、 I + フルオログリコフェン、 I + フルオログリコフェン - エチル、 I + フルオキサプロップ、 I + フルボキサム、 I + フルプロバシル、 I + フルプロパネート、 I + フルピルスルフロン、 I + フルピルスルフロン - メチル - ナトリウム、 I + フルレノール (f l u r e n o l)、 I + フルリドン、 I + フルロクロリドン、 I + フルロキシピル、 I + フルルタモン、 I + フルチアセツ、 I + フルチアセツ - メチル、 I + ホメサフェン、 I + ホラムスルフロン、 I + ホサミン、 I + グルホシネート、 I + グルホシネート - アンモニウム、 I + グリホサート、 I + ハロスルフロン、 I + ハロスルフロン - メチル、 I + ハロキシホップ、 I + ハロキシホップ - P、 I + ヘキサジノン、 I + イマザメタベンズ、 I + イマザメタベンズ - メチル、 I + イマザモックス、 I + イマザビック、 I + イマザピル、 I + イマザキン、 I + イマゼタピル、 I + イマゾスルフロン、 I + インダノファン、 I + インダジフラム、 I + ヨードメタン、 I + ヨードスルフロン、 I + ヨードスルフロン - メチル - ナトリウム、 I + イオキシニル、 I + イソプロツロン、 I + イソウロン、 I + イソキサベン、 I + イソキサクロルトール、 I + イソキサフルトール、 I + イソキサビリホップ、 I + カルブチラート、 I + ラクトフェン、 I + レナシル、 I + リニユロン、 I + メコプロップ、 I + メコプロップ - P、 I + メフェナセツ、 I + メフルイジド、 I + メソスルフロン、 I + メソスルフロン - メチル、 I + メソトリオン、 I + メタム、 I + メタミホップ、 I + メタミトロン、 I + メタザクロール、 I + メタベンズチアズロン、 I + メタゾール、 I + メチルアルソン酸、 I + メチルダイムロン、 I + イソチオシアン酸メチル、 I + メトラクロル、 I + S - メトラクロル、 I + メトスラム、 I + メトキスロン、 I + メトリブジン、 I + メトスルフロン、 I + メツルフロン - メチル、 I + モリネート、 I + モノリニユロン、 I + ナプロアニリド、 I + ナプロパミド、 I + ナブタラム、 I + ネブロン、 I + ニコスルフロン、 I + n - メチルグリホサート、 I + ノナン酸、 I + ノルフラゾン、 I + オレイン酸 (脂肪酸)、 I + オルベンカルブ、 I + オルソスルファミン、 I + オリザリン、 I + オキサジアルギル、

10

20

30

40

50

I + オキサジアゾン、I + オキサスルフロ、I + オキサジクロメホン、I + オキシフル
 オルフェン、I + パラコート、I + 二塩化パラコート、I + ペプレート、I + ペンディメ
 タリン、I + ペノキススラム、I + ペンタクロロフェノール、I + ペンタノクロル、I +
 ペントキサゾン、I + ペトキサミド、I + フェンメジファム、I + ピクロラム、I + ピコ
 リナフェン、I + ピノキサデン、I + ピペロホス、I + プレチラクロール、I + プリミス
 ルフロ、I + プリミスルフロ - メチル、I + プロジアミン、I + プロホキシジム、I +
 プロヘキサジオン - カルシウム、I + プロメトン、I + プロメトリン、I + プロバクロ
 ル、I + プロパニル、I + プロパキザホップ、I + プロパジン、I + プロファミ、I + プ
 ロピソクロール、I + プロボキシカルバゾン、I + プロボキシカルバゾン - ナトリウム、
 I + プロビザミド、I + プロスルホカルブ、I + プロスルフロ、I + ピラクロニル、I
 + ピラフルフェン、I + ピラフルフェン - エチル、I + ピラスルホトール、I + ピラゾリ
 ネット、I + ピラゾスルフロ、I + ピラゾスルフロ - エチル、I + ピラゾキシフェン
 、I + ピリベンゾキシム、I + ピリブチカルブ、I + ピリダフォル、I + ピリデート、I
 + ピリフタリド、I + ピリミノバック、I + ピリミノバック - メチル、I + ピリミスル
 ファン、I + ピリチオバック、I + ピリチオバック - ナトリウム、I + ピロキサスルホン、
 I + ピロクススラム、I + キンクロラック、I + キンメラック、I + キノクラミン、I +
 キザロホップ、I + キザロホップ - P、I + リムスルフロ、I + サフルフェナシル、I
 + セトキシジム、I + シデュロン、I + シマジン、I + シメトリン、I + 塩素酸ナトリウ
 ム、I + スルコトリオン、I + スルフェントラゾン、I + スルホメツロン、I + スルホメ
 ツロン - メチル、I + スルホサート、I + スルホスルフロ、I + 硫酸、I + テブチウロ
 ン、I + テフリルトリオン、I + テンボトリオン、I + テブラロキシジム、I + テルバシ
 ル、I + テルブメトン、I + テルブチラジン、I + テルブトリン、I + テニルクロール、
 I + チアゾピル、I + チフェンスルフロ、I + チエンカルバゾン、I + チフェンスル
 フロン - メチル、I + チオベンカルブ、I + トブラメゾン、I + トラルコキシジム、I + ト
 リ - アレート、I + トリアスルフロ、I + トリアジフラム、I + トリベヌロン、I + ト
 リベヌロン - メチル、I + トリクロピル、I + トリエタジン、I + トリフロキシスルフロ
 ン、I + トリフロキシスルフロ - ナトリウム、I + トリフルラリン、I + トリフルスル
 フロン、I + トリフルスルフロ - メチル、I + トリヒドロキシトリアジン、I + トリネ
 キサバック - エチル、I + トリトスルフロ、I + [3 - [2 - クロロ - 4 - フルオロ -
 5 - (1 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テト
 ラヒドロピリミジン - 3 - イル) フェノキシ] - 2 - ピリジルオキシ] 酢酸エチルエステ
 ル (C A S 登録番号 3 5 3 2 9 2 - 3 1 - 6) 。本発明の化合物はまた、国際公開第 0 6
 / 0 2 4 8 2 0 号パンフレットおよび / または国際公開第 0 7 / 0 9 6 5 7 6 号パンフレ
 ットに記載されている除草化合物と組み合わせることができる。

10

20

30

【 0 0 5 2 】

式 I の化合物の混合相手はまた、例えば The Pesticide Manual ,
 第 1 4 版 , British Crop Protection Council , 2 0 0
 6 中で述べられているようにエステルまたは塩の形態であってもよい。

【 0 0 5 3 】

式 I の化合物はまた、他の農薬、例えば殺真菌剤、殺線虫剤、または殺虫剤との混合物
 の状態で使用することもでき、それらの例は The Pesticide Manual
 中に示されている。

40

【 0 0 5 4 】

式 I の化合物と混合相手の混合比は、好ましくは 1 : 1 0 0 ~ 1 0 0 0 : 1 である。

【 0 0 5 5 】

これら混合物は、有利には前述の製剤において使用することができる (この場合、 「 有
 効成分 」 は、式 I の化合物と混合相手とのそれぞれの混合物に関係がある) 。

【 0 0 5 6 】

本発明による式 I の化合物はまた、1 種類または複数種類の毒性緩和剤と併用すること
 ができる。同様に、本発明による式 I の化合物と 1 種類または複数種類の更なる除草剤の

50

混合物もまた、1種類または複数種類の毒性緩和剤と併用することができる。毒性緩和剤は、AD67(MON 4660)、ペノキサコール、クロキントセット-メキシル、シプロスルファミド(CAS登録番号221667-31-8)、ジクロルミド、フェンクロラゾール-エチル、フェンクロリム、フルキソフェニム、フリラゾールとその対応するR異性体、イソキサジフェン-エチル、メフェンピル-ジエチル、オキサベトリニル、N-イソプロピル-4-(2-メトキシ-ベンゾイルスルファモイル)-ベンズアミド(CAS登録番号221668-34-4)であることができる。他の可能性には、例えば欧州特許第0365484号明細書に記載されている毒性緩和剤化合物、例えばN-(2-メトキシベンゾイル)-4-[(メチルアミノカルボニル)アミノ]ベンゼンスルホンアミドが挙げられる。式Iの化合物と、シプロスルファミド、イソキサジフェン-エチル、クロキントセット-メキシル、および/またはN-(2-メトキシベンゾイル)-4-[(メチルアミノカルボニル)アミノ]ベンゼンスルホンアミドとの混合物が特に好ましい。これらの毒性緩和剤は、高い割合(例えば>50g/ha)の式Iの化合物を使用する場合、トウモロコシおよび/または穀物、例えばコムギおよびオオムギにおいて特に良好な結果を示した。

【0057】

式Iの化合物の毒性緩和剤はまた、The Pesticide Manual, 第14版(BCPC), 2006中で述べられているようにエステルまたは塩の形態であることができる。クロキントセット-メキシルへの言及はまた、国際公開第02/34048号パンフレット中に開示されているように、そのリチウム塩、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩、アルミニウム塩、鉄塩、アンモニウム塩、第四アンモニウム塩、スルホニウム塩、またはホスホニウム塩にも適用され、またフェンクロラゾール-エチルへの言及はまた、フェンクロラゾールなどにも適用される。

【0058】

好ましくは式Iの化合物と毒性緩和剤の混合比は100:1~1:10、とりわけ20:1~1:1である。

【0059】

これら混合物は、有利には前述の製剤において使用することができる(この場合、「有効成分」は、式Iの化合物と毒性緩和剤とのそれぞれの混合物に関する)。

【0060】

本発明はさらに、作物植物と雑草を含む現場で雑草を選択的に駆除する方法を提供する。この方法は、その現場に本発明による組成物の雑草駆除量を施用することを含む。「駆除」とは、枯らすこと、成長を減じまたは遅らすこと、あるいは発芽を妨げまたは減らすことを意味する。一般には駆除される植物は、望まれていない植物(雑草)である。「現場」とは、植物が成長しつつある、または成長するであろう面域を意味する。

【0061】

式Iの化合物の施用量は幅広い限度内で変えることができ、土壌の性質、施用方法(発芽前または発芽後、種子粉衣、蒔き溝への散布、不耕起散布など)、その作物植物、駆除される雑草、支配的な気候条件、および施用の方法と、施用の回数と、標的作物とによって支配される他の要因に左右される。本発明による式Iの化合物は、一般には10~2000g/ha、とりわけ50~1000g/haの割合で散布される。

【0062】

散布は、通常はこの組成物を噴霧することによって、一般に広い面積の場合にはトラクターに装着した噴霧器によって行われるが、粉付け(粉末の場合)、滴下、または灌注などの他の方法もまた使用することができる。

【0063】

本発明による化合物を使用することができる有用な植物には、農作物、例えばオオムギおよびコムギなどの穀物、ワタ、アブラナ、ヒマワリ、トウモロコシ、コメ、ダイズ、テンサイ、サトウキビ、および芝が含まれる。トウモロコシが特に好ましい。

【0064】

作物植物にはまた、果樹、ヤシの木、ココヤシの木、または他の堅果などの樹木が挙げられる。ブドウなどのつる植物、果実灌木、果実植物、および野菜もまた含まれる。

【0065】

これら農作物には、従来の品種改良の方法によって、または遺伝子工学によって除草剤または数種の除草剤（例えば、ALS阻害剤、GS阻害剤、EPSPS阻害剤、PPO阻害剤、ACCアーゼ阻害剤、およびHPPD阻害剤）に対して耐性にされた農作物もまた含まれるものと理解されたい。従来の品種改良の方法によってイミダゾリノン、例えばイマザモックスに対して耐性にされた農作物の例は、Clearfield（登録商標）夏ナタネ（カノーラ）である。遺伝子工学の方法によって除草剤に対して耐性にされた農作物の例には、例えば、商標名Roundup Ready（登録商標）およびLiberty Link（登録商標）で市販されているグリホサート耐性およびグルホシネート耐性トウモロコシ品種が挙げられる。

10

【0066】

好ましい実施形態では作物植物は、遺伝子工学によってHPPD阻害剤に対して耐性にされる。作物植物をHPPD阻害剤に対して耐性にする方法は、例えば、国際公開第0246387号パンフレットから知られる。したがって、さらに好ましい実施形態ではその作物植物は、細菌由来の、より具体的にはフルオレッセンス菌（*Pseudomonas fluorescens*）または海洋細菌（*Shewanella colwelliana*）由来の、あるいは植物由来の、より具体的には単子葉植物由来の、またはさらに一層具体的にはオオムギ、トウモロコシ、コムギ、コメ、ビロードキビ属（*Brachiaria*）、クリノイガ属（*Chenchrus*）、ドクムギ属（*Lolium*）、フェスク属（*Festuca*）、セタリア属（*Setaria*）、オヒシバ属（*Eleusine*）、モロコシ属（*Sorghum*）、またはカラスムギ属（*Avena*）由来のHPPD阻害剤耐性HPPD酵素をコードするDNA配列を含むポリヌクレオチドに関してトランスジェニックである。

20

【0067】

農作物はまた、遺伝子工学の方法によって害虫に対して抵抗性にされたもの、例えばBtトウモロコシ（アワノメイガに抵抗性を示す）、Btワタ（メキシコワタミゾウムシに抵抗性を示す）、およびまたBtジャガイモ（コロラドハムシに抵抗性を示す）であると理解されたい。Btトウモロコシの例は、NK（登録商標）（Syngenta Seeds）のBt 176トウモロコシ交配種である。Bt毒素は、バシルス・チュウリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）土壌細菌によって天然で形成されるタンパク質である。これら毒素、またはこのような毒素を合成することができるトランスジェニック植物の例は、欧州特許出願公開第A-451 878号明細書、欧州特許出願公開第A-374 753号明細書、国際公開第93/07278号パンフレット、国際公開第95/34656号パンフレット、国際公開第03/052073号パンフレット、および欧州特許出願公開第A-427 529号明細書に記載されている。殺虫剤抵抗性をコードし、1種類または複数種類の毒素を発現させる1種類または複数種類の遺伝子を含むトランスジェニック植物の例は、KnockOut（登録商標）（トウモロコシ）、Yield Gard（登録商標）（トウモロコシ）、NuCOTIN33B（登録商標）（ワタ）、Bollgard（登録商標）（ワタ）、NewLeaf（登録商標）（ジャガイモ）、NatureGard（登録商標）、およびProtexcta（登録商標）である。これら植物作物またはそれらの種子材料は、除草剤に耐性を示し、また同時に昆虫摂食にも抵抗性を示すことができる（「積み重ね」遺伝子形質転換事象）。例えば種子は、グリホサートに対して耐性であると同時に殺虫Cry3タンパク質を発現させる能力を有する。

30

40

【0068】

これら農作物にはまた、品種改良または遺伝子工学の従来の方法によって得られ、かついわゆる出力形質（例えば、改良された貯蔵安定性、より高い栄養価、および改良された香味）を含有するものも含まれることを理解されたい。

50

【 0 0 6 9 】

他の有用な植物には、例えばゴルフコース、芝生、公園、および沿道中の芝草または芝土用に栽培された芝草と、花または灌木などの観賞植物とが挙げられる。

【 0 0 7 0 】

これら組成物を使用して望ましくない植物（まとめて「雑草」）を駆除することができる。駆除される雑草は、単子葉植物種、例えばヌカボ属（*Agrostis*）、スズメノテッポウ属（*Alopecurus*）、カラスムギ属（*Avena*）、ビロードキビ属（*Brachiaria*）、スズメノチャヒキ属（*Bromus*）、クリノイガ属（*Cenchrus*）、カヤツリグサ属（*Cyperus*）、メヒシバ属（*Digitaria*）、ヒエ属（*Echinochloa*）、オヒシバ属（*Eleusine*）、ドクムギ属（*Lolium*）、ミズアオイ属（*Monochoria*）、ツノアイアシ属（*Rottboellia*）、オモダカ属（*Sagittaria*）、ホタルイ属（*Scirpus*）、エノコログサ属（*Setaria*）、およびモロコシ属（*Sorghum*）、ならびに双子葉植物種、例えばイチビ属（*Abutilon*）、アマランサス属（*Amaranthus*）、ブタクサ属（*Ambrosia*）、アガサ属（*Chenopodium*）、キク属（*Chrysanthemum*）、イズハハコ属（*Conyza*）、ヤエムグラ属（*Galium*）、サツマイモ属（*Ipomoea*）、オランダガラシ属（*Nasturtium*）、キンゴジカ属（*Sida*）、シロガラシ属（*Sinapis*）、ナス属（*Solanum*）、ハコベ属（*Stellaria*）、クワガタソウ属（*Veronica*）、スミレ属（*Viola*）、およびオナモミ属（*Xanthium*）の両方であることができる。雑草にはまた、農作物と見なすことができるが、耕作面域外で成長している植物（「逸出植物」）、または別の農作物の以前の植付けの使い残しの種子から成長する植物（「自生植物」）が含まれる。このような自生植物または逸出植物は、ある種の他の除草剤に対して耐性である場合もある。

【 0 0 7 1 】

本発明の化合物は、下記の方法を用いて調製することができる。

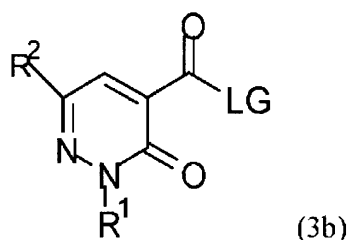
【 0 0 7 2 】

下記のスキームにおいて本発明の化合物の調製の概要を述べる。

【 0 0 7 3 】

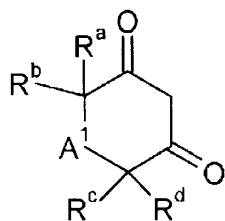
式（I）の化合物の調製は、既知の方法（例えば、国際公開第 97 / 4 6 5 3 0 号パンフレット、欧州特許第 0 3 5 3 1 8 7 号明細書、および米国特許第 6 , 4 9 8 , 1 2 5 号明細書に記載されているもの）に類似した方法で行われ、以下の式：

【 化 2 】



（式中、R¹およびR²の定義は式（I）の場合と同様であり、LGは適切な脱離基、例えば塩素などのハロゲン原子、あるいは4 - ニトロフェノキシなどのアルコキシまたはアリールオキシ基である）の化合物を、化合物

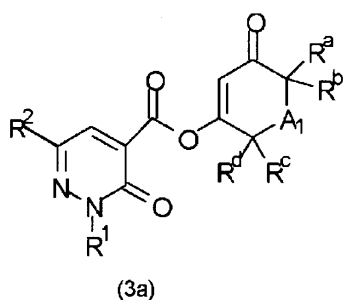
【化 3】



10

(式中、 A^1 、および R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d は以前に定義したものと同様である)と、ジクロロメタンまたはアセトニトリルなどの不活性有機溶媒中でトリエチルアミンなどの塩基の存在下で反応させてエステル(3a)

【化 4】



20

を得るステップを含む。このエステルを適切な塩基、例えばトリエチルアミンの存在下で触媒、例えば4-ジメチルアミノピリジン、またはアセトンシアノヒドリン、またはシアニ化ナトリウムなどのシアニ化金属塩を用いて転位させてスキーム1で示したような式(I)の化合物を得ることができる。溶媒中に最初に存在するまたは反応混合物のその他の成分に関連したいずれかの水が中間体の望ましくない加水分解を引き起こさないようにすることを確実にするために、反応媒体中にモレキュラーシーブなどの脱水剤を存在させるのが有利である。

30

【0074】

下記の非限定的調製試料を準備する。下記実施例中で使用される省略形は次のとおりである。s = 一重線、d = 二重線、t = 三重線、m = 多重線、bs = ブロード一重線、dd = ダブル二重線、dt = ダブル三重線、td = トリプル二重線、およびdq = ダブル四重線。

【実施例】

【0075】

40

実施例1: 2-(3-オキソ-2-フェニル-2,3-ジヒドロピリダジン-4-カルボニル)-シクロヘキサン-1,3-ジオン(化合物1.1)の調製

3-オキソ-2-フェニル-2,3-ジヒドロピリダジン-4-カルボン酸(0.52 g、2.42 mmol)を無水ジクロロメタン(13 mL)中で攪拌し、1滴の無水ジメチルホルムアミドを加えた。その懸濁液に塩化オキサリル(0.25 mL、2.90 mmol)を1滴ずつ加えて褐色溶液を得た。1.5時間後、その反応物を真空中で濃縮した。得られた残渣をジクロロメタン(20 mL)中に溶解した。この褐色溶液に無水トリエチルアミン(1 mL)、次いでシクロヘキサジオン(0.33 g、2.90 mmol)を加えて帯赤色の溶液を生成させた。さらなる0.33 mLの無水トリエチルアミンを加えた。この反応混合物を室温で2時間攪拌(反応をLCMSで監視)し、次いでアセトン

50

シアノヒドリン（１滴）および無水トリエチルアミン（０．６７ｍＬ）を加え、その反応混合物を一晩撹拌した。ＬＣＭＳは、所望の生成物が形成されたことを示した。この反応混合物を真空中で濃縮した。得られた残渣を、カラムクロマトグラフィー（ＳｉＯ₂、体積を基準にしてトルエン／トリエチルアミン／ジオキサン／ＥｔＯＨ／水＝１００：４０：２０：２０：５）を用いて精製し、次いでカラムクロマトグラフィー（ＳｉＯ₂、ヘキサン／酢酸エチル／酢酸＝２：１：０．０２から０：１００：２）によりさらに精製して表題の化合物をオレンジ色の油として得た（２５ｍｇ、収率３％）。¹H NMR（ＣＤＣｌ₃）２．０４（ｍ，２Ｈ）、２．６１（ｂｒ ｓ，４Ｈ）、７．１８（ｄ，１Ｈ）、７．４６（ｍ，２Ｈ）、７．５９（ｍ，３Ｈ）、７．９６（ｄ，１Ｈ）ｐｐｍ。

【００７６】

10

実施例２：２－（６－メチル－３－オキソ－２－フェニル－２，３－ジヒドロピリダジン－４－カルボニル）－シクロヘキサン－１，３－ジオン（化合物１．２）の調製

６－メチル－３－オキソ－２－フェニル－２，３－ジヒドロピリダジン－４－カルボン酸（０．５６ｇ、２．４２ｍｍｏｌ）を無水ジクロロメタン（１３ｍＬ）中で撹拌し、１滴の無水ジメチルホルムアミドを加えた。その黄色溶液に塩化オキサリル（０．２５ｍＬ、２．９０ｍｍｏｌ）を１滴ずつ加えた。１．５時間後、その反応物を真空中で濃縮した。得られた残渣をジクロロメタン（２０ｍＬ）中に溶解した。この褐色溶液に無水トリエチルアミン（１ｍＬ）、次いでシクロヘキサジオン（０．３３ｇ、２．９０ｍｍｏｌ）を加えて帯赤色の溶液を生成した。さらなる０．３３ｍＬの無水トリエチルアミンを加えた。この反応混合物を室温で２時間撹拌（反応をＬＣＭＳで監視）し、次いでアセトンシアノヒドリン（１滴）および無水トリエチルアミン（０．６７ｍＬ）を加え、その反応物を一晩撹拌した。ＬＣＭＳは、所望の生成物が形成されたことを示した。この反応混合物を真空中で濃縮した。得られた残渣を、カラムクロマトグラフィー（ＳｉＯ₂、体積を基準にしてトルエン／トリエチルアミン／ジオキサン／ＥｔＯＨ／水＝１００：４０：２０：２０：５）を用いて精製して、表題の化合物をオレンジ色の油として得た（３８２ｍｇ、４９％）。¹H NMR（ＣＤＣｌ₃）２．０５（ｑｕｉｎ，２Ｈ）、２．４１（ｍ，３Ｈ）、２．４７（ｂｒ ｓ，２Ｈ）、２．７３（ｂｒ ｓ，２Ｈ）、７．１０（ｓ，１Ｈ）、７．３６（ｍ，１Ｈ）、７．４６（ｍ，２Ｈ）、７．５７（ｍ，２Ｈ）、１６．１５（ｂｒ ｓ，１Ｈ）ｐｐｍ。

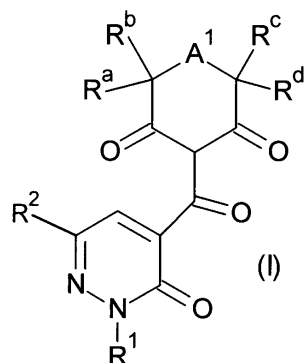
20

【００７７】

30

【表 1】

表1 - 本発明の除草性化合物の例



組成物	A ¹	R ^a	R ^c	R ^b	R ^d	R ¹	R ²	NMR ¹ H NMR (CDCl ₃)
1. 1	CH ₂	H	H	H	H	フェニル	H	2. 04 (m, 2H), 2. 61 (br s, 4H), 7. 18 (d, 1 H) 7. 46 (m, 2 H), 7. 59 (m, 3 H) 7. 96 (d, 1 H) ppm.
1. 2	CH ₂	H	H	H	H	フェニル	CH ₃	2. 05 (quin, 2H), 2. 41 (m, 3H), 2. 47 (br s, 2H), 2. 73 (br s, 2H), 7. 10 (s, 1H), 7. 36 (m, 1H), 7. 46 (m, 2H), 7. 57 (m, 2H), 16. 15 (br s, 1H) ppm.
1. 3	CH ₂	H	H	H	H		CH ₃	7. 45-7. 48 (2H, d), 7. 03 (1H, s), 6. 93-6. 95 (2H, d), 3. 82 (3H, s), 2. 47-2. 56 (4H, m), 2. 38 (3H, s), 1. 94-2. 13 (2H, m)
1. 4	CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -		H	H		CH ₃	16. 17 (1H, s), 7. 47-7. 50 (2H, m), 7. 07 (1H, s), 6. 94-6. 96 (2H, d), 3. 83 (3H, s), 3. 08-3. 10 (1H, br t), 2. 92-2. 95 (1H, br t), 2. 39 (3H, s), 2. 17-2. 24 (6H, m)
1. 5	CHCH ₃	H	H	H	H		CH ₃	16. 08 (1H, s), 7. 47-7. 49 (2H, d), 7. 10 (1H, s), 6. 94-6. 96 (2H, d), 3. 83 (3H, s), 2. 72-2. 78 (1H, br m), 2. 44-2. 58 (2H, br m), 2. 40 (3H, s), 2. 13-2. 37 (2H, br m), 1. 09-1. 11 (3H, d)
1. 6	CHCH ₃	H	H	H	H		CH ₃	UPLCMS, 5 min, t = 2. 34 min, m/z = 353 [M+H] ⁺
1. 7	CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -		H	H	フェニル	CH ₃	7. 39-7. 55 (5H, m), 7. 29-7. 31 (1H, s), 2. 93-3. 05 (2H, ブロード s), 2. 38-2. 42 (3H, s), 2. 16-2. 23 (3H, m), 1. 80-1. 90 (2H, ブロード m), 1. 74-1. 80 (1H, m)
1. 8	C=O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	フェニル	CH ₃	7. 39-7. 53 (6H, m), 2. 42-2. 44 (3H, s), 1. 38-1. 45 (12H, s),
1. 9	CHCH ₃	H	H	H	H	フェニル	CH ₃	7. 38-7. 55 (5H, m), 7. 29-7. 32 (1H, s), 2. 25-2. 68 (8H, ブロード m), 1. 07-1. 12 (3H, d)

【表 2】

組成物	A ¹	R ^a	R ^c	R ^b	R ^d	R ¹	R ²	NMR ¹ H NMR (CDCl ₃)
1. 10	CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -		H	H		CH ₃	7.88 (1H, t), 7.61 (1H, d), 7.32 (1H, d), 7.13 (1H, s), 3.04 (2H, brs), 2.69 (3H, s), 2.42 (3H, s), 2.23 (1H, d), 2.16 (2H, brs), 1.90 (2H, brs), 1.73 (1H, dt).
1. 11	CH ₂	H	H	H	H		CH ₃	7.95 (1H, t), 7.70 (1H, d), 7.37 (1H, d), 7.14 (1H, s), 2.73 (3H, s), 2.68 - 2.57 (4H, m), 2.43 (3H, s), 2.06 (2H, クインテット).
1. 12	C=O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃		CH ₃	16.47 (1H, s), 7.20-7.35 (5H, m), 2.43 (3H, s), 2.21 (3H, s), 1.52 (3H, s), 1.37 (3H, s).
1. 13	CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -		H	H		CH ₃	7.54 (2H, s), 7.38 (1H, s), 7.25 (1H, s), 3.06-3.14 (2H br, m), 2.23 (3H, s), 2.11-2.24 (4H, m), 1.98 (1H, m), 1.85 (1H, m).
1. 14	CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -		H	H		CH ₃	16.02 (1H, s), 7.25-7.32 (4H, m), 7.13 (1H, s), 3.08 (1H br, t), 2.82 (1H br, t), 2.4 (3H, s), 2.21 (3H, s), 1.97-2.18 (6H, m).
1. 15	CH ₂	H	H	H	H		CH ₃	7.7 (1H, s), 7.67 (2H, s), 7.38 (1H, s), 2.87 (1H, m), 2.58 (4H, m), 2.21 (3H, s), 2.09-2.18 (2H, m).
1. 16	CH ₂	H	H	H	H		CH ₃	16.02 (1H, s), 7.25-7.32 (4H, m), 7.17 (1H, s), 2.71 (2H, m), 2.45 (2H, m), 2.41 (3H, s), 2.21 (3H, s), 1.98-2.06 (2H, m).
1. 17	CHCH ₃	H	H	H	H		CH ₃	16.0 (s, 1H), 7.6 (m, 2H), 7.3 (m, 1H), 7.0 (s, 1H), 2.8 (m, 1H), 2.6 (m, 2H), 2.1 (m, 1H), 1.1 (d, 3H).
1. 18	CHCH ₃	H	H	H	H		CH ₃	7.3 (2H, m), 7.0 (3H, m), 3.8 (3H, s), 2.5 (2H, m), 2.4 (1H, m), 2.3 (3H, s), 2.1 (2H, m), 1.2 (3H, d).
1. 19	CH ₂	H	H	H	H		CH ₃	7.4 (1H, s), 7.1 (2H, s), 7.38 (2H, s), 3.8 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.4 (3H, s), 2.21 (2H, s), 2.07-2.15 (2H, m).
1. 20	CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -		H	H		CH ₃	7.4 (1H, s), 7.1 (2H, s), 7.38 (2H, s), 5.5 (1H, s), 3.8 (3H, s), 3.0 (2H, m), 2.0 (3H, m), 2.21 (6H, s), 2.07-2.15 (3H, m).

【0079】

生物学的実施例

様々な試験種の種子（スズメノテッポウ（*Alopecurus myosuroides*）（ALOMY）、アキノエノコログサ（*Setaria faberi*）（SETFA）、ヒエ（*Echinochloa crus-galli*）（ECHCG）、イチビ（*Abutilon theophrasti*）（ABUTH）、およびアオゲイトウ（*Amaranthus retroflexus*）（AMARE））を鉢中の標準的な土壌中に蒔く。温室中の制御された条件下（日中／夜間、24／16、14時間照明、湿度65％において）で1日間の栽培後（発芽前）または8日間の栽培後（出芽後）、植物に、Tween 20（ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、CAS登録番号9005-64-5）を0.5％含有するアセトン／水（50：50）溶液に溶かした工業用有効成分の製剤から得られる水性噴霧溶液を噴霧する。化合物は1000g／時で散布される。次いで試験植物を、温室中の制御された条件下（日中／夜間、24／16、14時間照明、湿度65％において）で温室中で成長させ、1日2回水を撒く。発芽前

および出芽後の 13 日後、植物に生じた除草剤によるダメージの割合について試験し評価する。生物学的活性を 5 段階評価（5 = ダメージ 80 ~ 100 %、4 = ダメージ 60 ~ 79 %、3 = ダメージ 40 ~ 59 %、2 = ダメージ 20 ~ 39 %、1 = ダメージ 0 ~ 19 %）で下記の表に示す。

【 0080 】

【表 3】

化合物	出芽後散布					発芽前散布				
	ABUTH	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG	ABUTH	AMARE	SETFA	ALOMY	ECHCG
1.1	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.2	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.7	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.8	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
1.9	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5

10

20

フロントページの続き

- (74)代理人 100093300
弁理士 浅井 賢治
- (74)代理人 100119013
弁理士 山崎 一夫
- (74)代理人 100123777
弁理士 市川 さつき
- (74)代理人 100111796
弁理士 服部 博信
- (74)代理人 100162422
弁理士 志村 将
- (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 100087871
弁理士 福本 積
- (74)代理人 100087413
弁理士 古賀 哲次
- (74)代理人 100117019
弁理士 渡辺 陽一
- (74)代理人 100141977
弁理士 中島 勝
- (74)代理人 100138210
弁理士 池田 達則
- (72)発明者 ジョナサン ウェズリー ポール ダリモア
イギリス国, ブラックネル アールジー 4 2 6 イーワイ, ジェロッツ ヒル インターナショナル リサーチ, センター

審査官 安藤 倫世

- (56)参考文献 特開 2 0 0 1 - 2 8 8 1 7 3 (J P , A)
独国特許出願公開第 0 4 4 2 3 9 3 4 (D E , A 1)
欧州特許出願公開第 0 0 2 8 3 2 6 1 (E P , A 1)
特表 2 0 0 3 - 5 0 5 4 5 2 (J P , A)
国際公開第 2 0 1 1 / 0 3 1 6 5 8 (W O , A 1)
特表 2 0 0 6 - 5 1 5 3 0 5 (J P , A)
特表 2 0 0 7 - 5 1 3 9 1 4 (J P , A)
国際公開第 2 0 0 7 / 0 8 8 8 7 6 (W O , A 1)

(58)調査した分野(Int.Cl. , D B 名)

C 0 7 D 2 3 7 / 1 4

A 0 1 N 4 3 / 5 8

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