

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第3959112号

(P3959112)

(45) 発行日 平成19年8月15日(2007.8.15)

(24) 登録日 平成19年5月18日(2007.5.18)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 239/54 (2006.01)

C O 7 D 239/54 Z

A O 1 N 43/54 (2006.01)

A O 1 N 43/54 F

A O 1 N 43/80 (2006.01)

A O 1 N 43/80 I O 1

C O 7 D 409/12 (2006.01)

C O 7 D 409/12

C O 7 D 413/12 (2006.01)

C O 7 D 413/12

請求項の数 8 (全 31 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願平8-533699
 (86) (22) 出願日 平成8年4月25日(1996.4.25)
 (65) 公表番号 特表平11-504637
 (43) 公表日 平成11年4月27日(1999.4.27)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP1996/001722
 (87) 国際公開番号 W01996/035679
 (87) 国際公開日 平成8年11月14日(1996.11.14)
 審査請求日 平成15年2月26日(2003.2.26)
 (31) 優先権主張番号 19516785.6
 (32) 優先日 平成7年5月8日(1995.5.8)
 (33) 優先権主張国 ドイツ(DE)

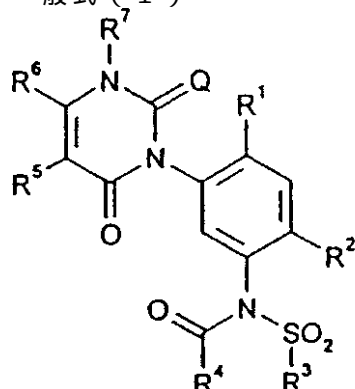
(73) 特許権者
 バイエル・アクチエンゲゼルシャフト
 ドイツ連邦共和国デー51368レーフェ
 ルクーゼン
 (74) 代理人
 弁理士 小田島 平吉
 (74) 代理人
 弁理士 小田嶋 平吾
 (72) 発明者
 アンドレー、ローラント
 ドイツ連邦共和国デー40764ランゲ
 ンフェルト・デヒヤントーミーバツハーベ
 ーク37
 (72) 発明者
 ドリユーズ、マーク・ウイルヘルム
 ドイツ連邦共和国デー40764ランゲ
 ンフェルト・ゲーテシユトラーセ38
 最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 除草剤及び殺虫剤としての置換アミノフェニルウラシル類

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(I)



(I)

式中、Qは酸素又は硫黄を表し、

R¹は水素、シアノ又はハロゲンを表し、R²はシアノ、チオカルバモイルを表すか、又は任意に置換されていてもよいアルキルを表し、R³はそれぞれ任意に置換されていてもよいアルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル又はヘテロアリールを表し、R⁴はそれぞれ任意に置換されていてもよいシクロアルキル、アリール又はヘテロアリー

ルを表し、

R^5 は水素、ハロゲンを表すか、又はそれぞれ任意に置換されていてもよいアルキル又はアルコキシを表し、

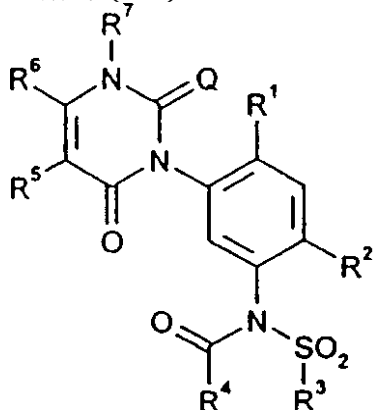
R^6 は任意に置換されていてもよいアルキルを表し、並びに

R^7 は水素、ヒドロキシル、アミノを表すか、又はそれぞれ任意に置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルケニル又はアルキニルを表す、

ことを特徴とする置換アミノフェニルウラシル類。

【請求項 2】

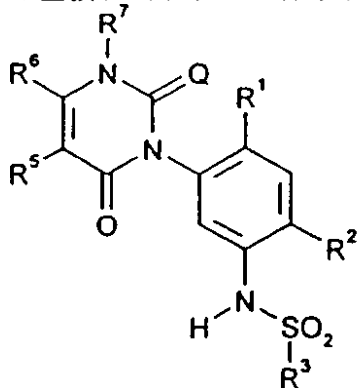
一般式 (I)



(I)

(式中、 Q 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及び R^7 は、それぞれ請求項 1 において定義したと同じである。)

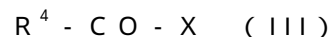
の置換アミノフェニルウラシル類の製造方法において、一般式 (II)



(II)

(式中、 Q 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及び R^7 は、それぞれ上で定義したと同じである。)

のスルホニルアミノフェニルウラシル類を、適切であれば反応助剤の存在下で、また、適切であれば希釈剤の存在下で、一般式 (III)



(式中、 R^4 は上で定義したと同じであり、 X はハロゲン又は $-O-CO-R^4$ 基を表わす。)

の酸誘導体と反応させることを特徴とする、一般式 (I) の置換アミノフェニルウラシル類の製造方法。

【請求項 3】

請求項 1 又は 2 に記載の一般式 (I) の置換アミノフェニルウラシル類を植物及び / 又はその自生地に作用させることを特徴とする、望ましくない植物を防除する方法。

【請求項 4】

請求項 1 又は 2 に記載の一般式 (I) の置換アミノフェニルウラシル類を増量剤及び / 又は界面活性剤と混合することを特徴とする、除草剤の製造方法。

【請求項 5】

請求項 1 又は 2 に記載の式 (I) の少なくとも 1 種の置換アミノフェニルウラシルを含ん

10

20

30

40

50

でなることを特徴とする除草剤。

【請求項 6】

請求項 1 又は 2 に記載の一般式 (I) の置換アミノフェニルウラシル類を昆虫及び / 又はその生息地に作用させることを特徴とする、望ましくない昆虫の防除方法。

【請求項 7】

請求項 1 又は 2 に記載の一般式 (I) の置換アミノフェニルウラシル類を増量剤及び / 又は界面活性剤と混合することを特徴とする、殺虫剤の製造方法。

【請求項 8】

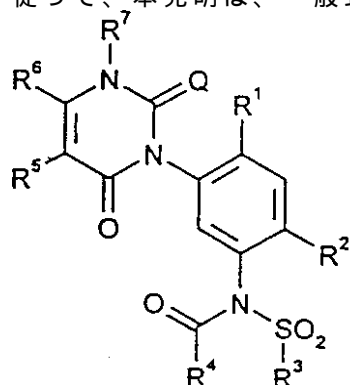
請求項 1 又は 2 に記載の式 (I) の少なくとも 1 種の置換アミノフェニルウラシルを含んでなることを特徴とする殺虫剤。

10

【発明の詳細な説明】

本発明は、新規な置換アミノフェニルウラシル類、それらの製造方法、及び、除草剤並びに殺虫剤としてのそれらの使用に関する。

ある置換アミノフェニルウラシル類は除草特性を備えていることが知られている (EP 408382 / US 5084084 / US 5127935 / US 5154755, EP 563384, DE 4412079 参照)。しかしながらそれらの置換アミノフェニルウラシル類は、これまで除草剤として又は殺虫剤として重要な地位を得るには至らなかった。従って、本発明は、一般式 (I) の新規な置換アミノフェニルウラシル類を提供する。



(I)

20

式中、Q は酸素又は硫黄を表し、

R¹ は水素、シアノ又はハロゲンを表し、

R² はシアノ、チオカーバモイル、ハロゲンを表すか、又は任意に置換されていてもよいアルキルを表し、

R³ はそれぞれ任意に置換されていてもよいアルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル又はヘテロアリールを表し、

R⁴ はそれぞれ任意に置換されていてもよいシクロアルキル、アリール又はヘテロアリールを表し、

R⁵ は水素、ハロゲンを表すか又はそれぞれ任意に置換されていてもよいアルキル又はアルコキシを表し、

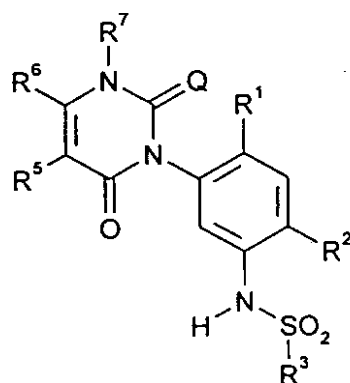
R⁶ は任意に置換アルキルを表し、並びに

R⁷ は水素、ヒドロキシル、アミノを表すか、又は、それぞれ任意に置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルケニル又はアルキニルを表す。

一般式 (I) の新規な置換アミノフェニルウラシル類は、一般式 (II)

30

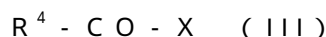
40



(II)

(式中、Q、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びR⁷はそれぞれ上で定義したと同じである)

の適切なスルホニルアミノフェニルウラシル類を、適切であれば反応助剤の存在下で、また、適切であれば希釈剤の存在下で一般式(III)



(式中、R⁴は上で定義したと同じであり、且つ、Xはハロゲン又は-O-CO-R⁴基を表す)

の酸誘導体と反応させることにより、得られる。

一般式(I)の新規な置換アミノフェニルウラシル類は強い除草活性と強い殺虫活性を備えている。

前記定義において、アルキル、アルケニル又はアルキニル等の飽和又は不飽和の炭化水素鎖はそれぞれの場合において直鎖又は枝分れ鎖である。

ハロゲンは、通常、弗素、塩素、臭素又はヨウ素、好ましくは弗素、塩素又は臭素、特に弗素又塩素を表す。

本発明は、好ましくは、

Qが酸素又は硫黄を表し、

R¹が水素、シアノ、弗素又は塩素を表し、

R²がシアノ、チオカルバモイル、弗素、塩素、臭素を表すか又は弗素及び/又は塩素で任意に置換されていてもよい、1個乃至4個の炭素原子を有するアルキルを表し、

R³がシアノ、弗素、塩素、臭素、C₁~C₄アルコキシ又はC₁~C₄アルキルチオで任意に置換されていてもよい、1個乃至6個の炭素原子を有するアルキルを表し、

更にR³がシアノ、弗素、塩素、臭素又はC₁~C₄アルキルで任意に置換されていてもよい、3個乃至8個の炭素原子を有するシクロアルキルを表し、

更にR³がフェニル、ナフチル、ベンジル、フェニルエチル、チエニル、ピラゾリル、ピリジニル又はキノリニルを表しており、それぞれの場合において可能な置換基は弗素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、カルボキシ、カルバモイル、チオカルバモイル、C₁~C₄アルキル、C₁~C₄アルコキシ、C₁~C₄アルキルチオ、ジメチルアミノスルホニル、ジエチルアミノスルホニル、それぞれ弗素及び/又は塩素で任意に置換されていてもよいC₁~C₄アルキルスルフィニル又はC₁~C₄アルキルスルホニル、それぞれ弗素、塩素、臭素、シアノ、メトキシ又はエトキシで任意に置換されていてもよいC₁~C₄アルコキシカルボニル、又はそれぞれ弗素、塩素、臭素、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル及び/又はトリフルオロメトキシで任意に置換されていてもよいフェニル、フェニルオキシ又はフェニルチオであり、

R⁴がシアノ、弗素、塩素、臭素又はC₁~C₄アルキルで任意に置換されていてもよい、3個乃至8個の炭素原子を有するシクロアルキルを表し、更に、R⁴がそれぞれ任意に置換されていてもよい、フェニル、ナフチル、フリル、チエニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、ピラゾリル、ピリジニル、ピリミジニル又はキノリニルを表しており、それぞれの場合において可能な置換基は、弗素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、カルボキシ、カルバモイル、チオカルバモイル、ジメチルアミノ、ジメチルアミノスルホニル、ジエチルアミノスルホニル、それぞれ弗素及び/又は塩素で任意に置換されていてもよいC₁~C₄ア

10

20

30

40

50

ルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル又は $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル又は弗素、塩素、臭素、シアノ、メトキシ又はエトキシで任意に置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルであり、

R^5 が水素、弗素、塩素、臭素を表すか、又はそれぞれ弗素及び/又は塩素で任意に置換されていてもよい、それぞれの場合1個乃至4個の炭素原子を有するアルキル又はアルコキシを表し、

R^6 が弗素及び/又は塩素で任意に置換されていてもよい、1個乃至4個の炭素原子を有するアルキルを表し、並びに

R^7 が水素、ヒドロキシル、アミノを表すか、又は、それぞれ弗素、塩素又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシで任意に置換されていてもよい、それぞれの場合6個までの炭素原子を有するアルキル、アルコキシ、アルケニル又はアルキニルを表す一般式(I)の化合物を提供する。

10

本発明は、特に、Qが酸素又は硫黄を表し、

R^1 がハロゲン、シアノ、弗素又は塩素を表し、

R^2 がシアノ、チオカルバモイル、弗素、塩素、臭素、メチル、エチル、 n -もしくは i -プロピル、 n -、 i -、 s -もしくは t -ブチル又はトリフルオロメチルを表し、

R^3 がそれぞれシアノ、弗素、塩素、メトキシ又はエトキシで任意に置換されていてもよい、メチル、エチル、 n -もしくは i -プロピル、 n -、 i -、 s -もしくは t -ブチルを表し、

更に、 R^3 がそれぞれシアノ、弗素、塩素、臭素、メチル、エチル、 n -もしくは i -プロピルで任意に置換されていてもよい、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルを表し、

20

更に、 R^3 がそれぞれ任意に置換されていてもよいフェニル、ナフチル、ベンジル、フェニルエチル、チエニル、ピラゾリル、ピリジニル又はキノリニルを表しており、可能な置換基が弗素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、カルボキシ、カルバモイル、チオカルバモイル、メチル、エチル、 n -もしくは i -プロピル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、 n -もしくは i -プロポキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、エチルチオ、 n -もしくは i -プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、 n -もしくは i -プロピルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、 n -もしくは i -プロピルスルホニル、ジメチルアミノスルホニル、ジエチルアミノスルホニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、 n -もしくは i -プロポキシカルボニルであり、 R^4 がシアノ、弗素、塩素、臭素、メチル、エチル、 n -プロピルもしくは i -プロピルで任意に置換されていてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルを表し、更に、

30

R^4 がそれぞれ任意に置換されていてもよいフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、ピリジニル、又はピリミジニルを表しており、それぞれの場合において可能な置換基は、弗素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、カルボキシ、カルバモイル、チオカルバモイル、ジメチルアミノ、ジメチルアミノスルホニル又はジエチルアミノスルホニル、それぞれ弗素及び/又は塩素で任意に置換されていてもよいメチル、エチル、 n -もしくは i -プロピル、メトキシ、エトキシ、 n -もしくは i -プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、 n -もしくは i -プロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、 n -もしくは i -プロピルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、 n -もしくは i -プロピルスルホニル、それぞれ弗素、塩素、臭素、シアノ、メトキシまたはエトキシで任意に置換されていてもよい、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、 n -もしくは i -プロポキシカルボニル、それぞれ弗素、塩素、臭素、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル及び/またはトリフルオロメトキシで任意に置換されていてもよいフェニル、フェニルオキシ又はフェニルチオであり、 R^5 が水素、弗素、塩素、臭素を表すか、又は、それぞれ弗素及び/又は塩素で任意に置換されていてもよいメチル、エチル、 n -もしくは i -プロピルを表し、

40

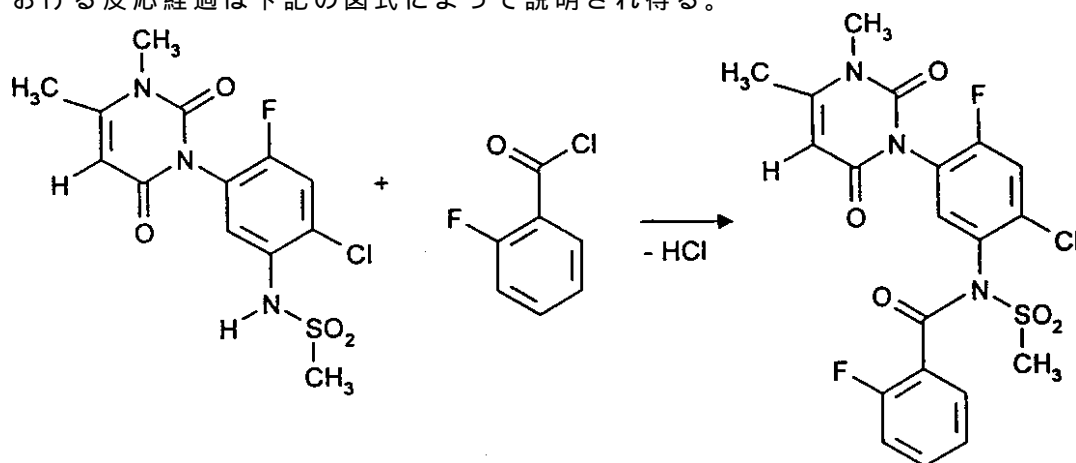
R^6 が弗素及び/又は塩素で任意に置換されていてもよいメチル、エチル、 n -もしくは

50

i - プロピルを表し、

R⁷が水素、アミノを表すか、又は、それぞれ弗素及び/又は塩素で任意に置換されていてもよいメチル、エチル、n - もしくはi - プロピル、n - , i - もしくはs - ブチル、メトキシ、エトキシ、n - もしくはi - プロポキシ、n - , i - もしくはs - ブトキシ、プロペニル、ブテニル、プロビニル又はブチニルを表す式(Ⅰ)の化合物を提供する。上記の一般的な又は好ましい基の定義は、式(Ⅰ)の最終生成物に対して妥当なものであり、また、それぞれの場合に製造に必要とされる出発物質又は中間体についても、対応する様式で妥当なものである。これらの基の定義は随意に相互に組み合わせることができる。すなわち、所定の好ましい範囲内での組み合わせも可能である。

例えば、出発物質として1 - (4 - クロロ - 2 - フルオロ - 5 - メチルスルホニルアミノ - フェニル) - 3, 6 - ジヒドロ - 2, 6 - ジオキソ - 3, 4 - ジメチル - 1(2H) - ピリミジンと、2 - フルオロ - ベンゾイルクロライドとを用いると、本発明による方法における反応経過は下記の図式によって説明され得る。



式(Ⅱ)は、式(Ⅰ)の化合物を製造するための本発明方法において、出発物質として用いられるべきスルホニルアミノフェニル - ウラシル類に関する一般的な定義を与える。式(Ⅱ)においてQ、R¹、R²、R³、R⁵、R⁶及びR⁷のそれぞれは、本発明に従って製造されるべき式(Ⅰ)の化合物の説明に関連して上で既に指摘された意味と同じであり、好ましいか又は特に好ましいとされる各基の意味も、好ましいか又は特に好ましいと上で既に指摘された意味と同じである。

式(Ⅱ)の出発物質は公知であり、及び/又はそれ自体公知の方法で製造され得る(E P 4 0 8 3 8 2 / U S 5 0 8 4 0 8 4 / U S 5 1 2 7 9 3 5 / U S 5 1 5 4 7 5 5、E P 5 6 3 3 8 4、D E 4 4 1 2 0 7 9 参照)。

式(Ⅲ)は、式(Ⅰ)の化合物を製造するための本発明方法における出発物質として更に用いられるべきハロゲン化アシルの一般的な定義を与える。式(Ⅲ)において、R⁴は、本発明に従って製造されるべき式(Ⅰ)の化合物の説明に関連して、上で既に指摘された意味と同じであり、好ましいか又は特に好ましいとされるR⁴の意味も、好ましいか又は特に好ましいと上で既に指摘された意味と同じであり、Xは好ましくは弗素、塩素又は臭素を表し、特に塩素を表す。

式(Ⅲ)の出発物質は合成用の公知の化学品である。

式(Ⅰ)の化合物を製造するための本発明方法は、好ましくは、適切な反応助剤の存在下で行われる。適切な反応助剤は、一般に、通常は無機又は有機の塩基又は酸受容体である。これらの反応助剤は、好ましくは、例えば、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム又は酢酸カルシウム、リチウムアミド、ナトリウムアミド、カリウムアミド又はカルシウムアミド、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸カルシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム又は炭酸水素カルシウム、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム又は水素化カルシウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム又は水酸化カルシウム、ナトリウムメトキシド又はカリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド又はカリウムエトキシド、ナトリウムn - もしくはi - プロポキシド、又は、カリウムn - もしくは

は i - プロポキシド、ナトリウム n - 、 i - 、 s - もしくは t - ブトキシド、又は、カリウム n - 、 i - 、 s - 又は t - ブトキシド等のアルカリ金属又はアルカリ土類金属酢酸塩、アミド類、炭酸塩、炭酸水素塩、水素化物、水酸化物、又はアルコキシド類を含み、更に例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、トリブチルアミン、エチル - ジイソプロピルアミン、N, N - ジメチル - シクロヘキシルアミン、ジシクロヘキシルアミン、エチルジシクロヘキシルアミン、N, N - ジメチル - アニリン、N, N - ジメチル - ベンジルアミン、ピリジン、2 - メチル - 、3 - メチル - 、4 - メチル - 、2, 4 - ジメチル - 、2, 6 - ジメチル - 、3, 4 - ジメチル - 及び 3, 5 - ジメチル - ピリジン、5 - エチル - 2 - メチル - ピリジン、4 - ジメチルアミノピリジン、N - メチルピペリジン、1, 4 - ジアザピシクロ [2 . 2 . 2] - オクタン (D A B C O)、1, 5 - ジアザピシクロ [4 . 3 . 0] - ノネ - 5 - エン (D B N)、又は 1, 8 - ジアザピシクロ [5, 4, 0] - ウンデセ - 7 - エン (D B U) 等の塩基性有機窒素化合物を包含する。

10

式 (I) の化合物を製造するための本発明方法は、好ましくは、希釈剤の存在下で行われる。適切な希釈剤は、一般に、通常の有機溶媒である。これらの有機溶媒は、好ましくは、例えばペンタン、ヘキサン、ヘプタン、石油エーテル、リグロイン、ベンジン、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ジクロロメタン (塩化メチレン)、トリクロロメタン (クロロホルム) 又はテトラクロロメタン等の脂肪族、脂環式及び芳香族の任意にハロゲン化された炭化水素類；例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル t - ブチルエーテル、エチル t - ブチルエーテル、メチル t - ペンチルエーテル (M T B E)、エチル t - ペンチルエーテル、テトラヒドロフラン (T H F)、1, 4 - ジオキサン、エチレングリコールジメチルエーテル、もしくは、エチレングリコールジエチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル、もしくは、ジエチレングリコールジエチルエーテル等のジアルキルエーテル類；例えば、アセトン、ブタノン (メチルエチルケトン)、メチル i - プロピルケトン又はメチル i - ブチルケトン等のジアルキルケトン類；例えば、アセトニトリル、プロピオニトリル、ブチロニトリル、又はベンゾニトリル等のニトリル類；例えば N, N - ジメチル - ホルムアミド (D M F)、N, N - ジメチル - アセトアミド、N - メチル - ホルムアニリド、N - メチル - ピロリドン又はヘキサメチル - リン酸トリアミド等のアミド類；例えば酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸 n - もしくは i - プロピル、酢酸 n - 、酢酸 i - もしくは s - ブチル等のエステル類；例えば、ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類；例えば、メタノール、エタノール、n - もしくは、i - プロパノール、n - 、i - 、s - もしくは t - ブタノール、エチレングリコールモノメチルエーテル、もしくは、エチレングリコールモノエチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、もしくは、ジエチレングリコールモノエチルエーテル等のアルカノール類；これらと水又は純粋な水との混合物を包含する。

20

30

本発明方法を行う際、比較的広い範囲にわたって反応温度を変えることができる。一般に、- 10 と + 150 の間の温度、好ましくは 0 と 100 の間の温度が用いられる。

本発明方法は、一般に、大気圧 (“ 常圧 ”) 下で行われる。しかしながら、高い圧力下、又は、一般に 0 . 1 バールと 10 バール間の減圧下で操作することも可能である。

40

本発明方法を行う際に、一般に等モル量の出発物質が用いられる。しかしながら、成分の一方を比較的大過剰に用いることも可能である。反応は、一般に、適切な希釈剤中で反応助剤を存在させて行われ、また、反応混合物は、一般に、必要とされる温度で数時間攪拌される。後処理 (w o r k - u p) は通常の方法に従って行われる (製造の実施例参照) 。

本発明による活性化合物は、落葉剤、乾燥剤、除莖剤 (h a u l m - k i l l e r s) として、特に除草剤として用いられ得る。雑草とは、最も広い意味で、望ましくない場所に生育するすべての植物と理解されるべきである。本発明による物質が非選択的除草剤として作用するか、又は選択的な除草剤として作用するかは、本来、用いる量に依存する。

50

本発明による活性化合物は、例えば、下記の植物に関連して用いられ得る。

次の属の双子葉雑草： カラシ属 (Sinapis)、マメグンバイナズナ属 (Lepidium)、ヤエムグラ属 (Galium)、ハコベ属 (Stellaria)、シカギク属 (Matricaria)、カミツレモドキ属 (Anthemis)、ガリンソガ属 (Galinsoga)、アカザ属 (Chenopodium)、イラクサ属 (Urtica)、キオン属 (Senecio)、ヒユ属 (Amaranthus)、スベリヒコ属 (Portulaca)、オナモミ属 (Xanthium)、ヒルガオ属 (Convolvulus)、サツマイモ属 (Ipomoea)、タデ属 (Polygonum)、セスパニア属 (Sesbania)、オナモミ属 (Ambrosia)、アザミ属 (Cirsium)、ヒレアザミ属 (Carduus)、ノゲシ属 (Sonchus)、ナス属 (Solanum)、イヌガラシ属 (Rorippa)、キカシグサ属 (Rotala)、アゼナ属 (Lindernia)、ラムウム属 (Lamium)、クワガタソウ属 (Veronica)、イチビ属 (Abutilon)、エメクス属 (Emex)、チョウセンアサガオ属 (Datura)、スミレ属 (Viola)、チシマオドリコ属 (Galeopsis)、ケシ属 (Papaver)、ケンタウレア属 (Centaurea)、シロツメクサ属 (Trifolium)、キンポウゲ属 (Ranunculus) 及びタンポポ属 (Taraxacum)。

10

次の属の双子葉作物： ワタ属 (Gossypium)、ダイズ属 (Glycine)、フダンソウ属 (Beta)、ニンジン属 (Daucus)、インゲンマメ属 (Phaseolus)、エンドウ属 (Pisum)、ナス属 (Solanum)、アマ属 (Linum)、サツマイモ属 (Ipomoea)、ソラマメ属 (Vicia)、タバコ属 (Nicotiana)、トマト属 (Lycopersicon)、ラッカセイ属 (Arachis)、アブラナ属 (Brassica)、アキノノゲシ属 (Lactuca)、キウリ属 (Cucumis) 及びウリ属 (Cucurbita)。

20

次の属の単子葉雑草： ヒエ属 (Echinochloa)、エノコログサ属 (Setaria)、キビ属 (Panicum)、メヒシバ属 (Digitaria)、アワガリエ属 (Phleum)、スズメノカタビラ属 (Poa)、ウシノケグサ属 (Festuca)、オヒシバ属 (Eleusine)、ブラキアリア属 (Brachiaria)、ドクムギ属 (Lolium)、スズメノチャヒキ属 (Bromus)、カラスムギ属 (Avena)、カヤツリグサ属 (Cyperus)、モロコシ属 (Sorghum)、カモジグサ属 (Agropyron)、シクノドン属 (Cynodon)、ミズアオイ属 (Monochoria)、テンツキ属 (Fimbristylis)、オモダカ属 (Sagittaria)、ハリイ属 (Eleocharis)、ホタルイ属 (Scirpus)、パスパルム属 (Paspalum)、カモノハシ属 (Ischaemum)、スペノクレア属 (Sphenoclea)、ダクチロクテニウム属 (Dactyloctenium)、ヌカボ属 (Agrostis)、スズメノテッポウ属 (Alopecurus) 及びアペラ属 (Apera)。

30

次の属の単子葉作物： イネ属 (Oryza)、トウモロコシ属 (Zea)、コムギ属 (Triticum)、オオムギ属 (Hordeum)、カラスムギ属 (Avena)、ライムギ属 (Secale)、モロコシ属 (Sorghum)、キビ属 (Panicum)、サトウキビ属 (Saccharum)、アナナス属 (Ananas)、クサスギカズラ属 (Asparagus) 及びネギ属 (Allium)。

40

しかしながら、本発明の活性化合物の使用は、これらの属にまったく限定されるものではなく、同様にして他の植物にも及ぶものである。

式(I)の化合物は、濃度に依存して、例えば工業地域及び鉄道線路、また、樹木が存在するか又は存在しない通路及び四角い広場の雑草を完全に防除するのに使用できる。

同様に該化合物は、多年生栽培植物中の雑草、例えば、森林、装飾樹木、果樹園、ぶどう園、柑橘類の果樹園、ナットの果樹園、バナナ農園、コーヒー農園、茶農園、ゴム栽培場、油ヤシ栽培場、ココア農園、小果樹林及びホップ畑中の雑草、芝地、芝生及び牧草地上の雑草を防除するのに使用でき、また、一年生作物中の雑草の選択的防除に使用できる。

50

本発明の式(Ⅰ)の化合物は、単子葉作物の出芽前及び出芽後における単子葉雑草及び双子葉雑草の選択的防除に特に適している。

該活性化化合物は、害虫(animal pests)、好ましくは、節足動物及び線虫類、特に、農業、林業、貯蔵生産品並びに材料の保護及び衛生の分野において遭遇する昆虫及びクモガタ網の動物を防除するのに適している。それらの化合物は、通常の敏感な種属並びに通常の抵抗力のある種属、及び、発育のすべての段階又は発育のある段階に対して活性である。上述の害虫には次のものが挙げられる： 等脚目(Isopoda)の中から、例えばオニスカス・アセルス(Oniscus asellus)、オカダンゴムシ(Armadillidium vulgare)及びボルセリオ・スカバー(Porcellio scaber)。

10

倍脚綱(Diplopoda)の中から、例えばブラニウルス・グットラタス(Blaniulus guttulatus)。

唇脚綱(Chilopoda)の中から、例えばゲオフィルス・カルポファグス(Geophilus carpophagus)及びスカチゲラ(Scutigera spp.)。

結合綱(Symphyla)の中から、例えばスカチゲレラ・イマキュラタ(Scutigerebella immaculata)。

シミ目(Thysanura)の中から、例えばレブシマ・サッカリナ(Lepisma saccharina)。

トビムシ目(Collembola)の中から、例えばオニチュウルス・アルマツス(O nychiurus armatus)。

20

直翅目(Orthoptera)の中から、例えばブラッタ・オリエンタリス(Blatta orientalis)、ワモンゴキブリ(Periplaneta americana)、ロイコファエ・マデラエ(Leucophaea maderae)、チャバネ・ゴキブリ(Blattella germanica)、アチータ・ドメスチクス(Acheta domesticus)、ケラ(Gryllotalpa spp.)、トノサマバッタ(Locusta migratoria migratorioides)、メラノプルス・ジフエレンチアリス(Melanoplus differentialis)及びシストセルカ・グレガリア(Schistocerca gregaria)。

30

ハサミムシ目(Dermaptera)の中から、例えばホルフィキュラ・アウリクラリア(Forficula auricularia)。

シロアリ目(Isoptera)の中から、例えばレチキュリテルメス(Reticulitermes spp.)。

シラミ目(Anoplura)の中から、例えばヒトジラミ(Pediculus humanus corporis)、ケミノジラミ(Haematopinus spp.)及びケモノホソジラミ(Linognathus spp.)。

ハジラミ目(Mallophaga)の中から、例えばケモノハジラミ(Trichodectes spp.)及びダマリネア(Damalinea spp.)。

アザミウマ目(Thysanoptera)の中から、例えばクリバネアザミウマ(Hercinothrips femoralis)及びネギアザミウマ(Thrips tabaci)。

40

半翅目(Heteroptera)の中から、例えばチャイロカメムシ(Eurygaster spp.)、ジスデルクス・インテルメジウス(Dysdercus intermedius)、ピエスマ・クワドラタ(Piesma quadrata)、ナンキンムシ(Cimex lectularius)、ロドニウス・プロリクス(Rhodnius prolixus)及びトリアトマ(Triatoma spp.)。

同翅目(Homoptera)の中から、例えばアレウロデス・ブラシカエ(Aleurodes brassicae)、ワタコナジラミ(Bemisia tabaci)、トリアレウロデス・バポラリオルム(Trialeurodes vaporarior

50

um)、ワタアブラムシ(*Aphis gossypii*)、ダイコンアブラムシ(*Brevicoryne brassicae*)、クリプトミズス・リビス(*Cryptomyzus ribis*)、アフィス・ファバエ(*Aphis fabae*)、アフィス・ポミ(*Aphis pomi*)、リンゴワタムシ(*Eriosoma lanigerum*)、モモコフキアブラムシ(*Hyalopterus arundinis*)、ムギヒゲナガアブラムシ(*Macrosiphum avenae*)、コブアブラムシ(*Myzus* spp.)、ペンフィグス(*Pemphigus* spp.)、ホップイボアブラムシ(*Phorodon humuli*)、フィロクセラ・パスタトリクス(*Phylloxera vastatrix*)、ムギクビレアブラムシ(*Rhopalosiphum padi*)、ヒメヨコバイ(*Empoasca* spp.)、ユースセリス・ピロバックス(*Euscelis bilobatus*)、ツماغロヨコバイ(*Nephotettix cincticeps*)、ミズキカタカイガラムシ(*Lecanium corni*)、オリーブカタカイガラムシ(*Saissetia oleae*)、ヒメトビウンカ(*Laodelphax striatellus*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、アカマルカイガラムシ(*Aonidiella aurantii*)、シロマルカイガラムシ(*Aspidiotus hederiae*)、プシュードコッカス(*Pseudococcus* spp.)及びキジラミ(*Psylla* spp.)。

鱗翅目(*Lepidoptera*)の中から、例えばワタアカミムシ(*Pectinophora gossypiella*)、ブパルス・ピニアリウス(*Bupalus piniarius*)、ケイマトビア・ブルマタ(*Cheimatobia brumata*)、リソコレチス・ブランカルデラ(*Lithocolletis blancardella*)、ヒポノミユウタ・パデラ(*Hyponomeuta padella*)、コナガ(*Plutella maculipennis*)、ウメケムシ(*Malacosoma neustria*)、クワノキンムケシ(*Euproctis chrysorrhoea*)、マイマイガ(*Lymantria* spp.)、ブッカラトリックス・スルベリエラ(*Bucculatrix thurberiella*)、ミカンハモグリガ(*Phyllocnistis citrella*)、ヤガ(*Agrotis* spp.)、ユークソア(*Euxoa* spp.)、フェルチア(*Feltia* spp.)、エアリアス・インスラナ(*Earias insulana*)、ヘリオチス(*Heliothis* spp.)、スボドプテラ・エキグア(*Spodoptera exigua*)、ヨトウムシ(*Mamestra brassicae*)、パノリス・フラメア(*Panolis flammea*)、ハスモンヨトウ(*Prodenia litura*)、シロナヨトウ(*Spodoptera* spp.)、トリコプルシア・ニ(*Tricoplusia ni*)、カルボカプサ・ポモネラ(*Carpocapsa pomonella*)、アオムシ(*Pieris* spp.)、ニカメイチュウ(*Chilo* spp.)、アワノメイガ(*Pyrausta nubilalis*)、スジコナマダラメイガ(*Ephestia kuehniella*)、ハチミツガ(*Galleria mellonella*)、ティネオラ・ビセリエラ(*Tineola bisselliella*)、ティネア・ペリオネラ(*Tinea pellionella*)、ホフマノフィラ・プシュードスプレテラ(*Hofmannophila pseudospretella*)、カコエシア・ポダナ(*Cacoecia podana*)、カプア・レチクラナ(*Capua reticulana*)、クリストネウラ・フミフェラナ(*Choristoneura fumiferana*)、クリシア・アンビグエラ(*Clysia ambiguella*)、チャハマキ(*Homona magnanima*)及びトルトリクス・ビリダナ(*Tortrix viridana*)。

鞘翅目(*Coleoptera*)の中から、例えば、アノビウム・プンクタツム(*Anobium punctatum*)、コナガシンクイムシ(*Rhizopertha dominica*)、インゲンマメゾウムシ(*Acanthoscelides obtectus*)、ブルキデイウス・オブテクタス(*Bruchidius obtectus*)

10

20

30

40

50

)、ヒロトルペス・バジュルス (*Hylotrupes bajulus*)、アゲラスチ
 カ・アルニ (*Agelastica alni*)、レプチノタルサ デセムリネアタ (*Leptinotarsa decemlineata*)、フェドン・コクレアリアエ (*Phaedon cochleariae*)、ジアブロチカ (*Diabrotica* spp.)、
 プシリオデス・クリソセファラ (*Psylliodes chrysocephala*)、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna varivestis*)、ア
 トマリア (*Atomaria* spp.)、ノコギリヒラタムシ (*Oryzaephilus surinamensis*)、ハナゾウムシ (*Anthonomus* spp.)
 、コクゾウムシ (*Sitophilus* spp.)、オチオリンクス・スルカッス (*Otiorrhynchus sulcatus*)、バショウゾウムシ (*Cosmopolites sordidus*)、シュートリンクス・アシミリス (*Ceuthorrynchus assimilis*)、ヒペラ・ポスチカ (*Hypera postica*)
 、カツオブシムシ (*Dermestes* spp.)、トロゴデルマ (*Trogoderma* spp.)、アントレヌス (*Anthrenus* spp.)、アタゲヌス (*Attagenus* spp.)、ヒラタキクイムシ (*Lyc tus* spp.)、メリゲテ
 ス・アエネウス (*Meligethes aeneus*)、ヒョウホンムシ (*Ptinus* spp.)、ニブス・ホロレウカス (*Niptus hololeucus*)、セ
 マルヒョウホンムシ (*Gibbium psylloides*)、コクヌストモドキ (*Tribolium* spp.)、チャイロコメノゴミムシダマシ (*Tenebrio molitor*)、コメツキムシ (*Agriotes* spp.)、コノデルス (*Conoderus* spp.)、メロロンサ・メロロンサ (*Melolontha melolontha*)、アムフィマロン・ソルスチチアリス (*Amphimallon solstitialis*) 及び コステリトラ・ゼアランジカ (*Costelytra zealandica*)。

膜翅目 (*Hymenoptera*) の中から、例えば マツハバチ (*Diprion* spp.)、ホブロカムバ (*Hoplocampa* spp.)、ラシウス (*Lasius* spp.)、イエヒメアリ (*Monomorium pharaonis*) 及び スズメバチ (*Vespa* spp.)。

双翅目 (*Diptera*) の中から、例えば ヤブカ (*Aedes* spp.)、ハマダラ
 カ (*Anopheles* spp.)、イエカ (*Culex* spp.)、キイロショウ
 ジョウバエ (*Drosophila melanogaster*)、イエバエ (*Musca* spp.)、ヒメイエバエ (*Fannia* spp.)、クロバエ・エリスロセファ
 ラ (*Calliphora erythrocephala*)、キンバエ (*Lucilia* spp.)、オビキンバエ (*Chrysomya* spp.)、クテレブラ (*Cuterebra* spp.)、ウマバエ (*Gastrophilus* spp.)、ヒツ
 ポボスカ (*Hyppobosca* spp.)、サシバエ (*Stomoxys* spp.)、ヒツジバエ (*Oestrus* spp.)、ウシバエ (*Hypoderma* spp.)、アブ (*Tabanus* spp.)、タニア (*Tannia* spp.)、ケバエ (*Bibio hortulanus*)、オスシネラ・フリト (*Oscinella frit*)、クロキンバエ (*Phorbia* spp.)、アカザモグリハナバエ (*Pegomyia hyoscyami*)、セラチチス・キャピタータ (*Ceratitis capitata*)、ミバエオレアエ (*Dacus oleae*)、及び ガガンボ・パルドーサ (*Tipula paludosa*)。

ノミ目 (*Siphonaptera*) の中から、例えば ケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*) 及び ナガノミ (*Ceratophyllus* spp.)。

蜘蛛形綱 (*Arachnida*) の中から、例えば スコルピオ・マウルス (*Scorpio maurus*) 及び ラトロデクタス・マクタンズ (*Latrodectus mactans*)。

ダニ目 (*Acarina*) の中から、例えば アシブトコナダニ (*Acarus siro*

)、ヒメダニ(*Argas spp.*)、カズキダニ(*Ornithodoros spp.*)、ワクモ(*Dermanyssus gallinae*)、エリオフィエス・リビス(*Eriophyes ribis*)、ミカンサビダニ(*Phyllocoptura oleivora*)、オウシマダニ(*Boophilus spp.*)、コイタマダニ(*Rhipicephalus spp.*)、アンブリオマ(*Amblyomma spp.*)、イボマダニ(*Hyalomma spp.*)、マダニ(*Ixodes spp.*)、キュウセンヒゼンダニ(*Psoroptes spp.*)、ショクヒヒゼンダニ(*Chorioptes spp.*)、ヒゼンダニ(*Sarcoptes spp.*)、ホコリダニ(*Tarsonemus spp.*)クローバハダニ(*Bryobia pratensis*)、ミカンリングハダニ(*Panonychus spp.*)及びナミハダニ(*Tetranychus spp.*)。 10

植物寄生線虫は、例えば、ネグサレセンチュウ(*Pratylenchus spp.*)、ラドホルス(*Radopholus spp.*)、ジチュレンクス(*Ditylenchus spp.*)、テイレンクルス(*Tylenchulus spp.*)、シストセンチュウ(*Heterodera spp.*)、グロボデラ(*Globodera spp.*)、ネコブセンチュウ(*Meloidogyne spp.*)、アフエレンコイデス(*Aphelenchoides spp.*)、ロンギドルス(*Longidorus spp.*)、クシフィネマ(*Xiphinema spp.*)、トリコドルス(*Trichodorus spp.*)、テイレンクス(*Tylenchus spp.*)、ヘリコティレンクス(*Helicotylenchus spp.*)及びロティレンクス(*Rotylenchus spp.*)を包含する。 20

活性化化合物は、液剤、エマルジョン、水和剤、懸濁剤、散剤、粉剤、ペースト、可溶性散剤、粒剤、懸濁エマルジョン濃縮物、活性化化合物を含浸させた天然物質並びに合成物質、及び重合体物質中のマイクロカプセル等の通常の製剤形態に変えることができる。

これらの製剤は、公知の方法、例えば、界面活性剤、すなわち、乳化剤及び/又は分散剤及び/又は泡沫形成剤を任意に用いて、活性化化合物を伸展剤(*extender*)、すなわち、液体溶媒及び/又は固体担体と混合して製造される。

伸展剤として水を用いる場合には、例えば有機溶媒は補助溶媒としても用いられ得る。液体溶媒としては、主として、キシレン、トルエン又はアルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン、クロロエチレン又は塩化メチレン等の塩素化芳香族炭化水素類 30 及び塩素化脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン又はパラフィン、例えば石油留分、鉱油及び植物油等の脂肪族炭化水素類、ブタノール又はグリコール等のアルコール類、それらのエーテル類並びにエステル類、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサノン等のケトン類、ジメチルホルムアミド及びジメチルスルホキシド等の強い極性溶媒及び水が適当である。

固体担体としては、例えば、アンモニウム塩；カオリン、クレイ、タルク、チョーク、石英、アタパルガイト、モンモリロナイト又は珪藻土等の粉碎された天然鉱物；高度分散シリカ、アルミナ及びケイ酸塩等の粉碎された合成鉱物が適当である。粒剤用の固体担体としては、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石及び白雲石等の粉碎且つ分別された天然岩石；無機粗粉及び有機粗粉からなる合成粒状物；おがくず、ココヤシの実のから、とう 40 もろこしの穂軸及びタバコの茎等の有機物質からなる粒状物が適当である。乳化剤及び/又は泡沫形成剤としては、例えば、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル類及びポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル類、例えばアルキルアリアルポリグリコールエーテル類、アルキルスルホン酸塩類、アルキル硫酸塩類、アリアルスルホン酸塩類、アルブミン加水分解生成物等の非イオン乳化剤及び陰イオン乳化剤が適当である。分散剤としては、例えば、リグニンサルファイト廃液及びメチルセルロースが適当である。

カルボキシメチルセルロース；アラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリビニルアセテート等の天然及び合成の重合体（散剤、粒剤又はラテックスの形態）；セファリン類及びレシチン類等の天然燐脂質類及び合成燐脂質類等の粘着剤は製剤に用いることができる。更に添加剤には、鉱物油及び植物油を用いることができる。 50

例えば、酸化鉄、酸化チタン及びプルシャンプルー等の無機顔料類；アリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料等の有機染料類等の着色剤、及び、鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデン及び亜鉛の塩類等の微量元素 (trace nutrients) を用いることができる。

当該製剤は、一般に、0.1 ~ 95 重量%の活性化化合物、好ましくは0.5 ~ 90 重量%の活性化化合物を包含する。

本発明の活性化化合物はそのまま用いるか、又は、それらの製剤の形態で、雑草防除用の公知の除草剤との混合物として使用することができる。混合物は、最終の製剤形態に調整したものであってもよく、又は、使用する際にタンクミックスしたものであってもよい。

混合物用の適切な共同成分 (co - components) は、公知の除草剤、例えばジフルフェニカン (diflufenican) 及びプロパニル (propafluralin) 等のアニリド類；例えばジクロロピコリン酸 (dichloropicolinic acid)、ジカンバ (dicamba) 及びピクロラム (picloram) 等のアリールカルボン酸類；例えば2,4-D、2,4-DB、2,4-DP、フルロキシピル (fluroxypyr)、MCPA、MCPP及びトリクロピル (triclopyr) 等のアリールオキシアルカン酸類；例えばジクロホップ - メチル (diclofop - methyl) フェノックスプロップ - エチル (fenoxaprop - ethyl)、フルアジホップ - ブチル (fluazifop - butyl)、ハロキシホップ - メチル (haloxyfop - methyl) 及びクイザロホップ - エチル (quizalofop - ethyl) 等のアリールオキシ - フェノキシ - アルカン酸エステル類；例えばクロリダゾン (chloridazon) 及びノルフルラゾン (norflurazon) 等のアジノン類；例えばクロルプロファン (chlorpropham)、デスメジファン (desmedipham)、フェンメジファン (phenmedipham) 及びプロファン (proflumetsulfuron) 等のカーバメート類 (carbamates)；例えばアラクロル (alachlor)、アセトクロル (acetochlor)、ブタクロル (butachlor)、メタザクロル (metazachlor)、メトラクロル (metolachlor)、プレチラクロル (pretilachlor) 及びプロバクロル (propachlor) 等のクロロアセトアニリド類；例えば、オリザリン (oryzalin)、ペンジメタリン (pendimethalin) 及びトリフルラリン (trifluralin) 等のジニトロアニリン類；例えば、アシフルオルフェン (acifluorfen)、ビフェノックス (bifenox)、フルオログリコフェン (fluoroglycofen)、ホメサフェン (fomesafen)、ハロサフェン (haloxyfop)、ラクトフェン (lactofen) 及びオキシフルオロフェン (oxyfluorfen) 等のジフェニルエーテル類；例えば、クロルトロン (chlortoluron)、ジユロン (diuron)、フルオメチュロン (fluometuron)、イソプロチュロン (isoproturon)、リニユロン (linuron) 及びメタベンチアズロン (methabenzthiazuron) 等の尿素類；例えば、アロキキシジム (alloxydim)、クレソジム (clethodim)、シクロキシジム (cycloxydim)、セソキシジム (sethoxydim) 及びトラルコキシジム (tralkoxydim) 等のヒドロキシアミン類；例えば、イマゼサピル (imazethapyr)、イマザメサベンツ (imazamethabenz)、イマザピル (imazapyr) 及びイマザクイン (imazaquin) 等のイミダゾリノン類；例えば、ブロモキシニル (bromoxynil)、ジクロベニル (dichlobenil) 及びイオキシニル (ioxynil) 等のニトリル類；例えば、メフェナセツ (mefenacet) 等のオキシアセトアミド類；例えば、アミドスルフロン (amidosulfuron)、ベンスルフロン - メチル (bensulfuron - methyl)、クロリムロン - エチル (chlorimuron - ethyl)、クロルスルフロン (chlorsulfuron)、シノスルフロン (cinosulfuron)、メトスルフロン - メチル (metsulfuron - methyl)、ニコスルフロン (nicosulfuron)、プリミスルフロン (primisulfuron)、ピラゾ

10

20

30

40

50

スルフロン - エチル (pyrazosulfuron - ethyl)、チフェンスルフロ
ン - メチル (thi fensulfuron - methyl)、トリアスルフロ
ン (triasulfuron) 及びトリベニユロン - メチル (tribenuron - meth
yl) 等のスルホニル尿素類；例えば、酪酸エステル (butylate)、シクロエー
ト (cycloate)、ジアレート (diallate)、EPTC、エスプロカーブ
(esprocarb)、モリネート (molinate)、プロスルフォカーブ (pr
osulfocarb) チオベンカーブ (thiobencarb) 及びトリアレート (tr
iallate) 等のチオカーバメート類；例えば、アトラジン (atrazine
)、サイアナジン (cyanazine)、シマジン (simazine)、シメトリン
(simetryne)、ターブトリン (terbutryne) 及びターブチラジン (ter
butylazine) 等のトリアジン類；例えば、ヘキサジノン (hexazi
none)、メタミトロン (metamitron) 及びメトリブジン (metribu
zin) 等のトリアジノン類；例えば、アミノトリアゾール (aminotriazol
e)、ベンフレセート (benfuresate)、シンメチリン (cinmethylin)、
クロマゾン (clomazone)、クロピラリド (clopyralid)、ジフェンゾクエート (difenzoquat)、ジチオピル (dithiopyr)、
エソフメセート (ethofumesate)、フルオロクロリドン (fluorochloridone)、グルホシネート (glufosinate)、グリホセート (gly
phosate)、イソキサベン (isoxaben)、ピリデート (pyridate)、キンクロラック (quinchlorac)、キンメラック (quinmerac
)、スルホセート (sulphosate) 及びトリジファン (tridiphane)
等のその他のものである。

10

20

殺菌・殺カビ剤、殺虫剤、ダニ駆除剤 (acaricides) 線虫駆除剤 (nemat
icides)、鳥忌避剤 (bird repellants)、植物の栄養素、及び土
壌構造改良剤等の他の公知の活性化合物と混合することも可能である。

活性化合物は、そのまま、それらの製剤の形態で、又は更に希釈することによってそれら
から製造された、すぐに使用できる溶液、懸濁液、エマルジョン、散剤、ペースト及び粒
剤等の使用形態で用いられ得る。活性化合物は、通常の方法で、例えば撒水 (water
ing)、噴霧 (spraying、atomizing) 又は散布することによって使用される。

30

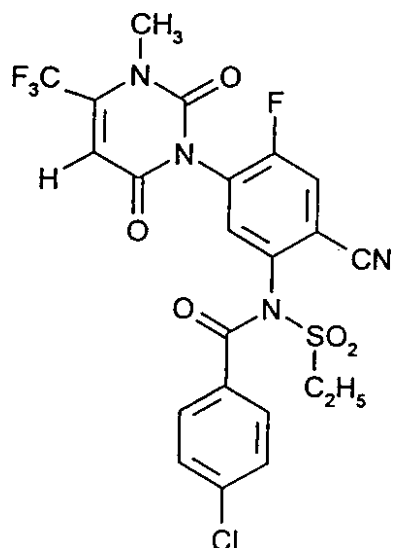
本発明の活性化合物は、植物の発芽前又は発芽後のいずれかの段階において施用すること
ができる。それらの活性化合物は播種前に、土壤中に取り込ませることもできる。

活性化合物の使用量は実質的な範囲内で変えることができる。この使用量は、本来、所望
する効果の大きさに依存する。一般に、使用量は、1ヘクタールの土壌表面当たり活性化
化合物 1 g ~ 10 kg、好ましくはヘクタール当たり 5 g ~ 5 kg である。

本発明の活性化合物の製造及び使用は以下の実施例から諒解され得る。

製造実施例

実施例 1

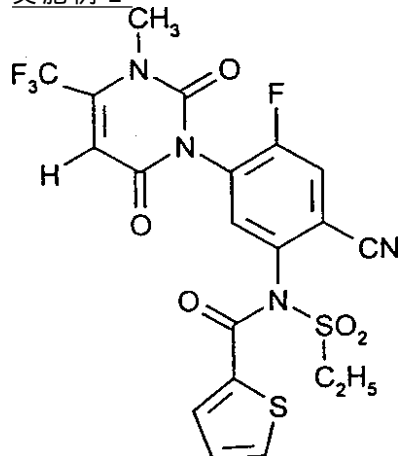


10

約 20 において、0.90 g (5 ミリモル) の 4 - クロロ - ベンゾイル クロライドを、2.1 g (5 ミリモル) の 1 - (4 - シアノ - 5 - エチルスルホニルアミノ - 2 - フルオロ - フェニル) - 3, 6 - ジヒドロ - 2, 6 - ジオキソ - 3 - メチル - 4 - トリフルオロメチル - 1 (2 H) - ピリミジン、0.60 g (6 ミリモル) の トリエチルアミン 及び 50 ml の アセトニトリルの混合物中に加える。この反応混合物を 2 時間の間 20 で攪拌する。次に、水流真空ポンプ (water pump vacuum) を用いてこの混合物を濃縮し、残留物をクロロホルム中に取り出し、2 N 塩酸で洗滌し、硫酸ナトリウムを用いて乾燥し、濾過する。この濾液を水流真空ポンプ (water pump vacuum) を用いて濃縮し、残留物をジエチルエーテルで温浸 (digest) し、得られる結晶性生成物を吸引濾過して単離する。1.5 g (理論値の 54 %) の 1 - [4 - ジアノ - 5 - (N - エチルスルホニル - N - (4 - クロロベンゾイル) アミノ) - 2 - フルオロ - フェニル] - 3, 6 - ジヒドロ - 2, 6 - ジオキソ - 3 - メチル - 4 - トリフルオロメチル - 1 (2 H) - ピリミジン (融点 138) が得られる。

20

実施例 2



30

約 20 において、1.8 g (12 ミリモル) の チオフェン - 2 - カルボニル クロライドを、2.1 g (5 ミリモル) の 1 - (4 - シアノ - 5 - エチルスルホニルアミノ - 2 - フルオロ - フェニル) - 3, 6 - ジヒドロ - 2, 6 - ジオキソ - 3 - メチル - 4 - トリフルオロメチル - 1 (2 H) - ピリミジン、1.5 ml の ピリジン、及び、50 ml の 塩化メチレンからなる混合物に加え、この反応混合物を 20 で一週間の間攪拌する。次に、この溶液を 1 N 塩酸で洗滌し、硫酸ナトリウムを用いて乾燥し、濾過する。濾液を水流真空ポンプ (Water pump vacuum) を用いて濃縮し、残留物をジエチルエーテルで温浸 (digest) し、得られる結晶性生成物を吸引濾過して単離する。

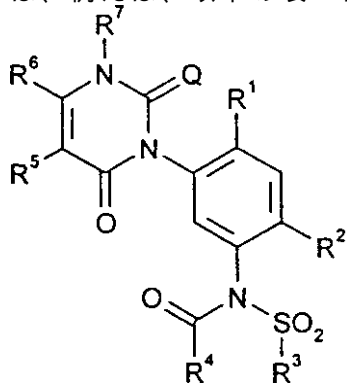
40

融点 192 の 1 - [4 - シアノ - 5 - (N - エチルスルホニル - N - (チエン - 2 - イル - カルボニル) アミノ) - 2 - フルオロ - フェニル] - 3, 6 - ジヒドロ - 2, 6 - ジ

50

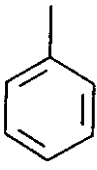
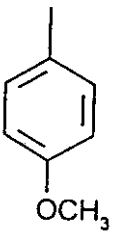
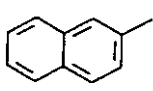
オキソ - 3 - メチル - 4 - トリフルオロメチル - 1 (2 H) - ピリミジン 2 . 1 g (理論値の 8 4 %) を得る。

実施例 1 及び 2 と同様な処理により、且つ、本発明の製造方法に関する一般的説明に従えば、例えば、以下の表 1 に掲載される式 (I) の化合物を製造することも可能である。

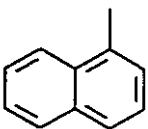


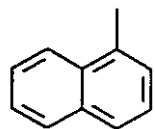
(I)

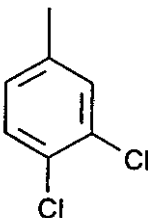
表 1 : 式 (I) の化合物の例

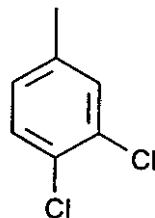
実施例 番号	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	融点(℃) point (°C)
3	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	93
4	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	108
5	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	157
6	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	190

実施例 番号	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	融点(°C)
-----------	---	----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	--------

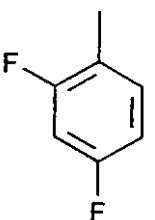
7	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	186
---	---	---	----	-------------------------------	---	---	-----------------	-----------------	-----

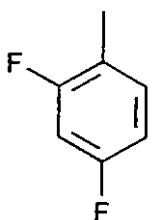


8	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	206
---	---	---	----	-------------------------------	---	---	-----------------	-----------------	-----

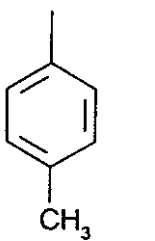


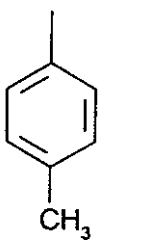
10

9	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	123
---	---	---	----	-------------------------------	---	---	-----------------	-----------------	-----

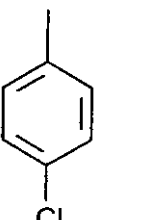


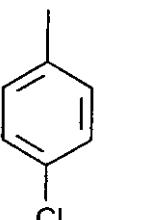
20

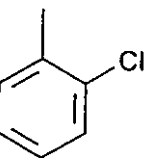
10	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	191
----	---	---	----	-------------------------------	---	---	-----------------	-----------------	-----

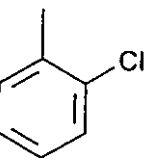


30

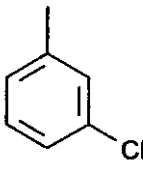
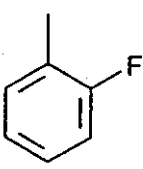
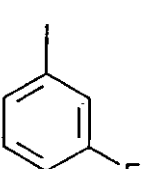
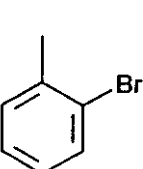
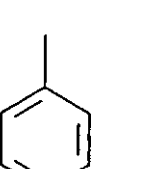
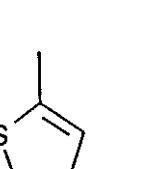
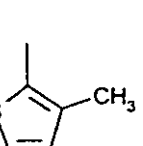
11	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	215
----	---	---	----	-----------------	---	---	-----------------	-----------------	-----



12	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	189
----	---	---	----	-----------------	---	---	-----------------	-----------------	-----

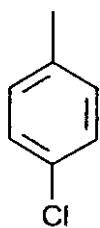


40

実施例 番号	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	融点(℃)	
13	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	189	
14	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	201	10
15	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	175	
16	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	184	20
17	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	193	
18	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	203	30
19	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	202	40

実施例 番号	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	融点(℃)
-----------	---	----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	-------

20	O	H	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	
----	---	---	----	-----------------	--	---	-----------------	-----------------	--



10

21	O	Cl	Cl	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	
----	---	----	----	-----------------	--	---	-----------------	-----------------	--

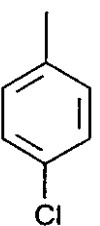


22	O	H	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	
----	---	---	----	-------------------------------	--	---	-----------------	-----------------	--



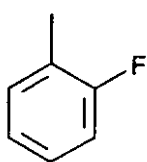
20

23	O	F	CN	n-C ₃ H ₇		H	CF ₃	CH ₃	
----	---	---	----	---------------------------------	--	---	-----------------	-----------------	--

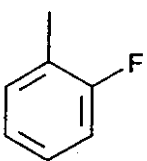


30

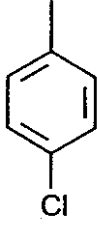
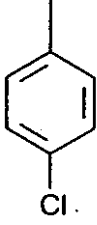
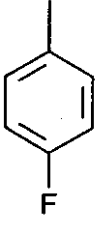
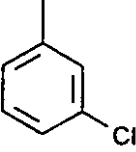
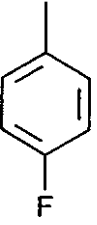
24	O	F	CN	n-C ₄ H ₉		H	CF ₃	CH ₃	
----	---	---	----	---------------------------------	--	---	-----------------	-----------------	--



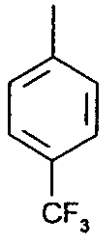
25	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	C ₂ H ₅	
----	---	---	----	-----------------	--	---	-----------------	-------------------------------	--

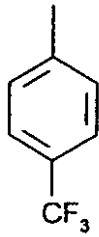


40

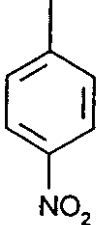
実施例 番号	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	融点(°C)
26	O	Cl	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	10
27	O	Cl	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	
28	O	Cl	CN	n-C ₃ H ₇		H	CF ₃	CH ₃	20
29	O	F	CN	i-C ₃ H ₇		CH ₃	CF ₃	C ₂ H ₅	30
30	O	F	CN			H	CF ₃	CH ₃	

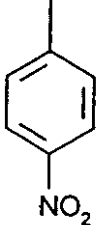
実施例 番号	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	融点(℃)
-----------	---	----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	-------

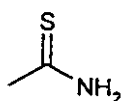
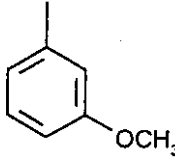
31	O	F	CN	n-C ₄ H ₉		H	CF ₃	NH ₂	
----	---	---	----	---------------------------------	---	---	-----------------	-----------------	--

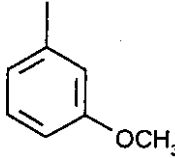
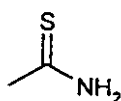


10

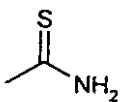
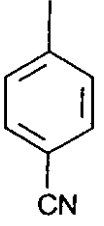
32	O	F	CN	i-C ₄ H ₉		H	CF ₂ Cl	CH ₃	
----	---	---	----	---------------------------------	---	---	--------------------	-----------------	--

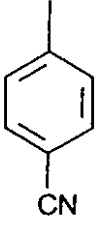
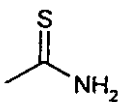


33	O	Cl		CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	
----	---	----	---	-----------------	--	---	-----------------	-----------------	--

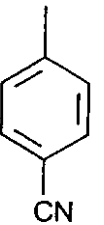


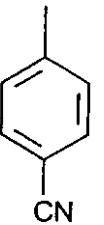
20

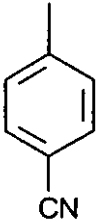
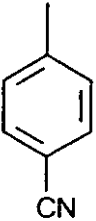
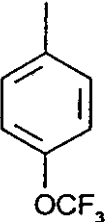
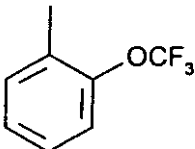
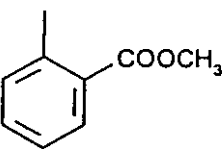
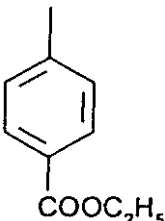
34	O	F		CH ₃		H	C ₂ F ₅	CH ₃	
----	---	---	---	-----------------	---	---	-------------------------------	-----------------	--

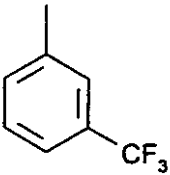
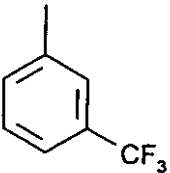
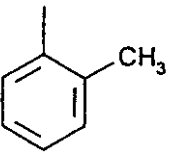
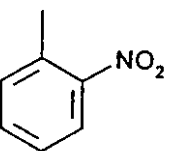
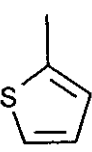
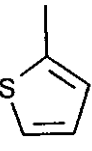
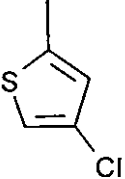


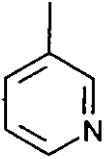
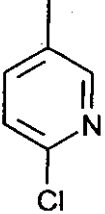
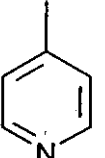
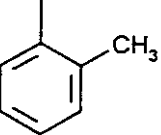
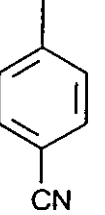
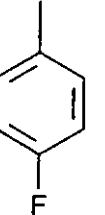
30

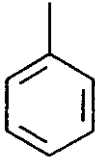
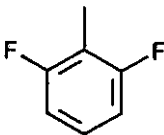
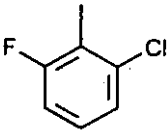
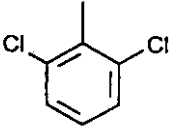
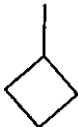
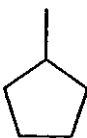
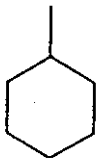
35	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	
----	---	---	----	-----------------	---	---	-----------------	-----------------	--

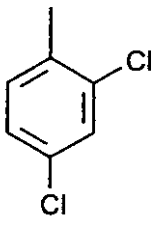
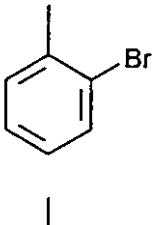
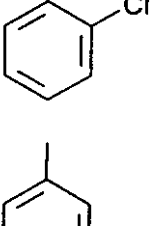
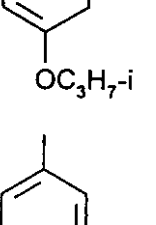
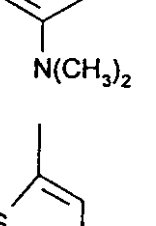
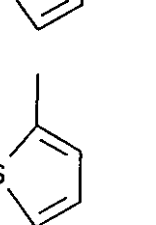
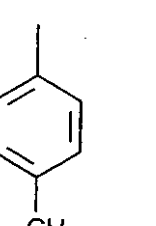


実施例 番号	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	融点(℃)
36	O	F	CN	CH ₃		H	CHF ₂	CH ₃	10
37	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	20
38	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	30
39	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	40
40	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	
41	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CHF ₂	CH ₃	

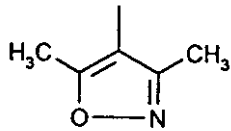
实施例 番号	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	融点(℃)
42	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	
43	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	10
44	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	20
45	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	
46	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	NH ₂	268
47	S	F	CN	C ₂ H ₅		CH ₃	CF ₃	CH ₃	30
48	O	F	CN	n-C ₃ H ₇		H	CF ₃	CH ₃	40

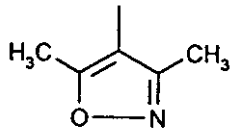
实施例 番号	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	融点(°C)
49	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	
50	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	10
51	S	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	20
52	S	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	
53	S	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	30
54	S	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	40

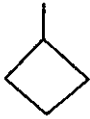
実施例 番号	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	融点(℃)
55	S	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	
56	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	10
57	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	20
58	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	
59	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	173
60	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	192
61	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	188
62	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	188

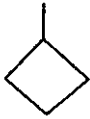
実施例 番号	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	融点(℃)	
63	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	122	
64	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	164	10
65	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	159	
66	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	107	20
67	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	CH ₃	198	30
68	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	H	187	
69	O	F	CN	C ₂ H ₅		H	CF ₃	NH ₂	120	40
70	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	227	

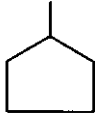
実施例 番号	Q	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	融点(°C)
-----------	---	----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	--------

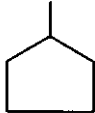
71	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	241
----	---	---	----	-----------------	---	---	-----------------	-----------------	-----

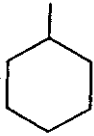


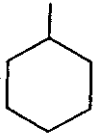
72	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	219
----	---	---	----	-----------------	---	---	-----------------	-----------------	-----

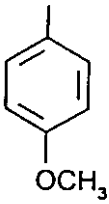


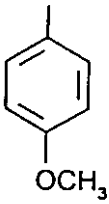
73	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	199
----	---	---	----	-----------------	---	---	-----------------	-----------------	-----

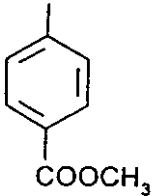


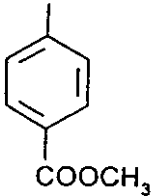
74	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	178
----	---	---	----	-----------------	--	---	-----------------	-----------------	-----



75	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	222
----	---	---	----	-----------------	---	---	-----------------	-----------------	-----



76	O	F	CN	CH ₃		H	CF ₃	CH ₃	225
----	---	---	----	-----------------	---	---	-----------------	-----------------	-----



10

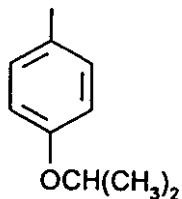
20

30

40

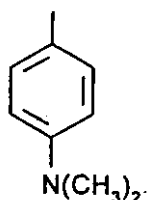
実施例 Q R¹ R² R³ R⁴ R⁵ R⁶ R⁷ 融点(℃)
番号

77 O F CN CH₃ H CF₃ CH₃ 195



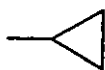
10

78 O F CN CH₃ H CF₃ CH₃ 216

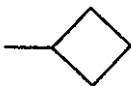


20

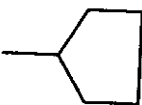
79 O F CN C₂H₅ H CF₃ NH₂ 89



80 O F CN C₂H₅ H CF₃ NH₂ 105



81 O F CN C₂H₅ H CF₃ NH₂ >200



30

使用の実施例：

実施例 A

発芽前テスト

溶媒： アセトン 5 重量部

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル 1 重量部

活性化合物からなる適切な調剤を製造するために、1 重量部の活性化合物を、上記量の溶媒と混合し、上記量の乳化剤を加え、濃厚液を所望の濃度まで水で希釈する。

40

テスト植物の種子を通常の土壌中にまき、24 時間後、活性化合物からなる調剤を撒水又は噴霧する。単位面積当たりの水量を一定に保つと有利である。調剤中の活性化合物の濃度は重要ではなく、単位面積当たりに施用される活性化合物の量のみが重要である。3 週間後、未処理の対照植物の発育と比較して、植物の損傷度合いを損傷パーセントで評価する。

数字の内容は次の通りである：

0 % = 効果なし（未処理の対照植物と同程度）

100 % = 完全な駆除

このテストにおいて、例えば、製造実施例 1 および 2 の化合物は、60 g / ヘクタールの施用率で、カヤツリグサ属 (cyperus) (60 ~ 100 %)、ホソムギ属 (lol

50

ium) (70~90%)、キビ属 (panicum) (70~95%)、イチビ属 (abutilon) (100%)、アカザ属 (chenopodium) (100%) 及び
 チョウセンアサガオ属 (datura) (100%) 等の雑草に対して極めて強力な活性
 を示し、例えば、トウモロコシ (maize) (0%) 等の作物は極めて良好な耐性を備
 えている。

実施例 B

発芽後テスト

溶媒： アセトン 5重量部

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル 1重量部

活性化合物からなる適切な調剤を製造するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒 10
 と混合し、上記量の乳化剤を加え、濃厚液を水で希釈して所望の濃度にする。

単位面積当たりに要求される特定量の活性化合物を施用する方法で、5~15cm高さの
 テスト植物に、活性化合物からなる薬剤を噴霧する。噴霧液の濃度は活性化合物の特定の
 混合量が1000リットル/ヘクタール中に施用されるように選択される。3週間後、未
 処理の対照植物の発育と比較して植物の損傷率を損傷%で評価する。

数字の内容は次の通りである：

0% = 効果なし (未処理植物と同程度)

100% = 完全な駆除

このテストにおいて、例えば、製造実施例1及び2の化合物は、30g/ヘクタールの施
 用率で、ヒエ属 (echinocloa) (95%)、モロコシ属 (sorghum) 20
 (70~80%)、イチビ属 (abutilon) (100%)、アカザ属 (cheno
 podium) (100%)、チョウセンアサガオ属 (datura) (100%) 及び
 ナス属 (solanum) (100%) 等の雑草に対して極めて強力な活性を示し、例え
 ば、オオムギ (barley) (0~10%) 等の作物は良好な耐性を備えている。

実施例 C

ダイコンハムシ (Phaedon) の幼虫テスト

溶媒： ジメチルホルムアミド 7重量部

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル 1重量部

活性化合物からなる適切な調剤を製造するために、1重量部の活性化合物を、上記量の溶 30
 媒及び上記量の乳化剤と混合し、濃厚液を水で希釈して所望の濃度にする。

キャベツ (Brassica oleracea) の葉を所望濃度の活性化合物からなる
 薬剤中に浸漬して処理し、キャベツの葉が湿っている間にマスタードビートル (must
 ard beetle) の幼虫 (Phaedon cochleariae) を寄生させ
 る。

所望の期間後に、駆除パーセントを決定する。100%はビートル (甲虫) の幼虫が全部
 殺されたことを意味し、0%はビートルの幼虫のいずれもが殺されなかったことを意味す
 る。

このテストにおいて、例えば、製造実施例1及び2の化合物は0.1%の活性化合物濃度
 で、7日後に80~100%の駆除を生じさせた。

実施例 D

ツマグロヨコバイ (Nephotettix) テスト

溶媒： ジメチルホルムアミド 7重量部

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル 1重量部

活性化合物からなる適切な調剤を製造するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒 40
 及び上記量の乳化剤と混合し、濃厚液を水で希釈して所望の濃度にする。

イネ (Oryza sativa) の苗を所望の濃度の活性化合物からなる薬剤中に浸漬
 し、苗がまだ湿っている間にグリーンライスリーフホッパー (green rice l
 eaf hopper) [ツマグロヨコバイ (Nephotettix cinctice
 ps)] の幼虫を寄生させる。

所望の期間後に、駆除パーセントを決定する。100%はリーフホッパーが全部殺された 50

ことを意味し、0 % はリーフホッパーのいずれもが殺されなかったことを意味する。
このテストにおいて、例えば、製造実施例 1 及び 2 の化合物は 0 . 1 % の活性化合物濃度
で 6 日後に 1 0 0 % の駆除を生じさせた。

フロントページの続き

(51) Int.Cl. F I
C 0 7 D 401/12 (2006.01) C 0 7 D 401/12

- (72)発明者 ドリンガー, マルクス
ドイツ連邦共和国デー - 5 1 3 8 1 レーフエルクーゼン・ブルシヤイダーシュトラッセ 1 5 4 ベー
(72)発明者 ザンテル, ハンス - ヨアヒム
ドイツ連邦共和国デー - 5 1 3 7 1 レーフエルクーゼン・グリユンシュトラッセ 9 アー
(72)発明者 エルデレン, クリストフ
ドイツ連邦共和国デー - 4 2 7 9 9 ライヒリンゲン・ウンテルビュシヤーホフ 1 5

審査官 伊藤 幸司

- (56)参考文献 特開平 0 5 - 1 8 6 4 3 6 (J P , A)
特開平 0 3 - 2 0 4 8 6 5 (J P , A)
特公昭 4 8 - 0 4 3 4 9 6 (J P , B 1)
特開昭 5 7 - 0 8 5 3 6 2 (J P , A)

(58)調査した分野(Int.Cl., D B 名)

C07D

A01N

CAPLUS(STN)

REGISTRY(STN)