

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号
特許第7195932号
(P7195932)

(45)発行日 令和4年12月26日(2022.12.26)

(24)登録日 令和4年12月16日(2022.12.16)

(51)国際特許分類

C 07 D 401/04 (2006.01)	F I	C 07 D 401/04
C 07 D 401/14 (2006.01)		C 07 D 401/14
A 01 N 43/54 (2006.01)		A 01 N 43/54
A 01 P 13/00 (2006.01)		A 01 P 13/00

C S P

F

請求項の数 16 (全199頁)

(21)出願番号 特願2018-561519(P2018-561519)
 (86)(22)出願日 平成29年5月22日(2017.5.22)
 (65)公表番号 特表2019-516755(P2019-516755)
 A)
 (43)公表日 令和1年6月20日(2019.6.20)
 (86)国際出願番号 PCT/EP2017/062262
 (87)国際公開番号 WO2017/202768
 (87)国際公開日 平成29年11月30日(2017.11.30)
 審査請求日 令和2年5月22日(2020.5.22)
 (31)優先権主張番号 16171063.7
 (32)優先日 平成28年5月24日(2016.5.24)
 (33)優先権主張国・地域又は機関
 欧州特許庁(EP)

(73)特許権者 508020155
 ピーエーエスエフ ソシエタス・ヨーロ
 ピア
 B A S F S E
 ドイツ連邦共和国 6 7 0 5 6 ルードウ
 イッヒスハーフェン・アム・ライン カ
 ール・ボッシュ・ストラーゼ 3 8
 C a r l - B o s c h - S t r a s s e
 3 8 , 6 7 0 5 6 L u d w i g s h a
 f e n a m R h e i n , G e r m a
 n y
 (74)代理人 110002572
 弁理士法人平木国際特許事務所
 (72)発明者 ザイザー, トビアス
 ドイツ連邦共和国 6 7 1 1 7 リンブル
 最終頁に続く

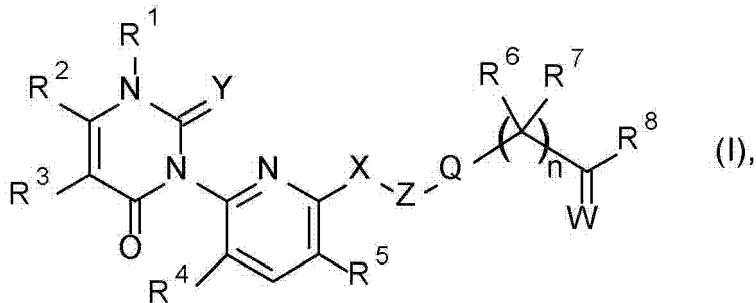
(54)【発明の名称】 ウラシルピリジン除草剤

(57)【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



[式中、可変要素は、以下の意味を有する:]

R¹は、水素、NH₂、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-アルキニルであり；R²は、水素、C₁-C₆-アルキル又はC₁-C₆-ハロアルキルであり；R³は、水素又はC₁-C₆-アルキルであり；R⁴は、H又はハロゲンであり；R⁵は、ハロゲン、CN、NO₂、NH₂、CF₃又はC(=S)NH₂であり；

R^6 は、H、ハロゲン、CN、 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、 C_1 - C_3 -アルキルチオ、(C_1 - C_3 -アルキル)アミノ、ジ(C_1 - C_3 -アルキル)アミノ、 C_1 - C_3 -アルコキシ- C_1 - C_3 -アルキル、又は C_1 - C_3 -アルコキシカルボニルであり；

R^7 は、H、ハロゲン、 C_1 - C_3 -アルキル、又は C_1 - C_3 -アルコキシであり；

R^8 は、 OR^9 、 SR^9 、 $NR^{10}R^{11}$ 、 NR^9OR^9 、 $NR^9S(O)_2R^{10}$ 又は $NR^9S(O)_2NR^{10}R^{11}$ であり、

R^9 は、水素、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -アルケニル、 C_3 - C_6 -アルキニル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -ハロアルケニル、 C_3 - C_6 -ハロアルキニル、 C_1 - C_6 -シアノアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルキル、ジ(C_1 - C_6 -アルコキシ) C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルコキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -アルケニルオキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -ハロアルケニルオキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -アルキルチオ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキルスルフィニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキルスルホニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキルカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -アルケニルオキシカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -アルキニルオキシカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -アルキル、アミノ、(C_1 - C_6 -アルキル)アミノ、ジ(C_1 - C_6 -アルキル)アミノ、(C_1 - C_6 -アルキルカルボニル)アミノ、アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、(C_1 - C_6 -アルキル)アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、ジ(C_1 - C_6 -アルキル)アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、アミノカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 $(C_1$ - C_6 -アルキル)アミノカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、ジ(C_1 - C_6 -アルキル)アミノカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、

$-N=CR^{12}R^{13}$ (R^{12} 及び R^{13} は、互いに独立して、H、 C_1 - C_4 -アルキル又はフェニルである)、

C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -ヘテロシクリル、 C_3 - C_6 -ヘテロシクリル- C_1 - C_6 -アルキル、フェニル、フェニル- C_1 - C_4 -アルキル又は5員若しくは6員のヘテロアリールであり、

シクロアルキル環、ヘテロシクリル環、フェニル環又はヘテロアリール環はそれぞれ、 R^{14} から選択される1~4個の置換基又は3~7員の炭素環により置換されていてよく、

この炭素環は、炭素原子に加えて、 $-N(R^{12})-$ 、 $-N=N-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-O-$ 及び $-S-$ からなる群から選択される1又は2個の環員を場合により有しており、

この炭素環は、 R^{14} から選択される1~4個の置換基により場合により置換されており、

R^{14} は、ハロゲン、 NO_2 、CN、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ又は C_1 - C_4 -アルコキシカルボニルであり、

R^{10} 、 R^{11} は、互いに独立して、 R^9 であるか、又は一緒になって3~7員の環を形成し、

この環は、 R^{10} 及び R^{11} が結合しているN原子及び炭素原子に加えて、 $-N(R^{12})-$ 、 $-N=N-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-O-$ 及び $-S-$ からなる群から選択される1又は2個の環員を場合により有しており、

この環は、 R^{14} から選択される1~4個の置換基により場合により置換されており；

n は、1~3であり；

Qは、 CH_2 、O、S、 SO 、 SO_2 、NH又は(C_1 - C_3 -アルキル)Nであり；

Wは、O又はSであり；

Xは、NH、 NCH_3 、O又はSであり；

Yは、O又はSであり；

Zは、それぞれ、ハロゲン、CN、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、及び C_1 - C_6 -ハロアルコキシからなる群から選択される、1~4個の置換基により場合により置換されている、フェニル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル又はピラジニルである]

のウラシルピリジン(それらの農業上許容可能な塩を含む)。

10

20

30

40

50

【請求項 2】

R^1 が、 C_1 - C_6 -アルキルであり、 R^2 が、 C_1 - C_4 -ハロアルキルであり、 R^3 がHであり、 Y が、Oである、請求項1に記載の式(I)のウラシルピリジン。

【請求項 3】

R^4 が、H又はFであり、 R^5 が、F、Cl、Br又はCNである、請求項1又は2に記載の式(I)のウラシルピリジン。

【請求項 4】

R^6 が、H、 C_1 - C_3 -アルキル又は C_1 - C_3 -アルコキシであり、 R^7 がHである、請求項1から3のいずれかに記載の式(I)のウラシルピリジン。

【請求項 5】

R^8 が、 OR^9 、 $NR^9S(O)_2R^{10}$ 又は $NR^9S(O)_2NR^{10}R^{11}$ であり、

R^9 が、水素、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -アルケニル、 C_3 - C_6 -アルキニル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルキル、ジ(C_1 - C_6 -アルコキシ) C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキルカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル又は C_3 - C_6 -シクロアルキル- C_1 - C_6 -アルキルであり、

R^{10} 、 R^{11} が、 C_1 - C_6 -アルキルである、

請求項1から4のいずれかに記載の式(I)のウラシルピリジン。

【請求項 6】

n が1である、請求項1から5のいずれかに記載の式(I)のウラシルピリジン。

【請求項 7】

Q 、 W 及び X がOである、請求項1から6のいずれかに記載の式(I)のウラシルピリジン。

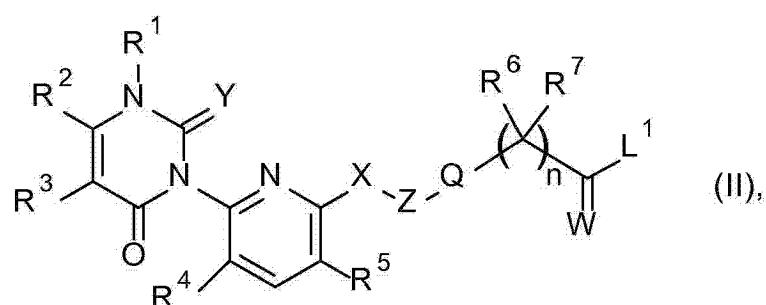
【請求項 8】

Z が、フェニル又はピリジルであり、これらがそれぞれ、ハロゲン、CN、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ及び C_1 - C_6 -ハロアルコキシからなる群から選択される、1~4個の置換基により場合により置換されている、請求項1から7のいずれかに記載の式(I)のウラシルピリジン。

【請求項 9】

式(II)

【化 2】



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 n 、 Q 、 W 、 X 、 Y 及び Z は、請求項1から8のいずれかに定義されているとおりであり、

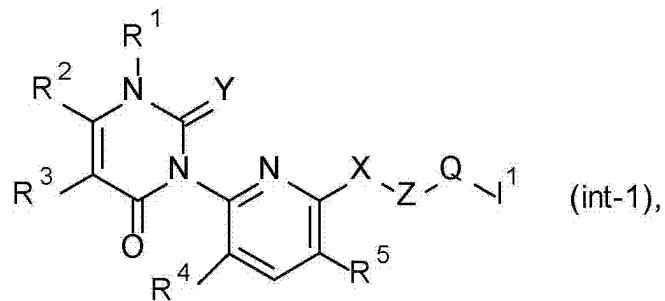
L^1 は、ハロゲンである)

の酸ハロゲン化物。

【請求項 10】

式(int-1)

【化3】



10

(式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、Q、X、Y及びZは、請求項1から8のいずれかに定義されているとおりであり、

I¹は、H又はPGであり、PGは、

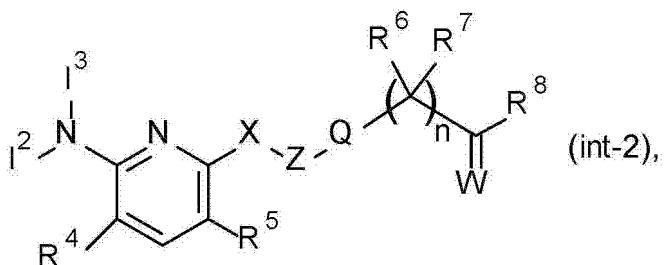
C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シルクロアルキル-C₁-C₄-アルキル、C₅-C₆-シクロアルケニル、テトラヒドロピラニル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル、ホルミル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル、C₁-C₆-アルキル-O-カルボニル、C₂-C₆-アルケニル-O-カルボニル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル-C₁-C₄-アルキル、フェニル-C₁-C₄-アルキル、フェニルチオ-C₁-C₆-アルキル、及びフェニルカルボニルからなる群から選択される保護基であり、

フェニル環はそれぞれ、ハロゲン、CN、NO₂、C₁-C₄-アルキル及びC₁-C₄-アルコキシからなる群から選択される1~3個の置換基により置換されていてもよい)の中間体(それらの塩を含む)。

【請求項11】

式(int-2)

【化4】



30

[式中、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、n、Q、W、X及びZは、請求項1から8のいずれかに定義されているとおりであり、

I²は、Hであり、

I³は、H又はC(=Y)L²であり、

Yは、O又はSであり、

L²は、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ又はアリールオキシ(アリール部分は、それ自体、部分的に若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、並びに/又はシアノ、ニトロ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-アルキルチオからなる群からの1~3個の置換基により置換されていてもよい)であるか、

又はI²とI³は、それらが結合しているN原子と一緒にになって、基「YCN」(YはO又はSである)、

又は基「PGN」(これは、N₃、脂肪族又は芳香族カルバメート、脂肪族又は芳香族アミド、N-C₁-C₆-アルキル-アミン、N-アリール-アミン又はヘテロアリールアミドからなる群

40

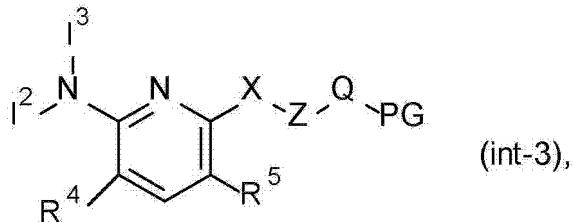
50

から選択される、保護アミン置換基である)を形成する]
の中間体(それらの塩を含む)。

【請求項 1 2】

式(int-3)

【化 5】



10

[式中、R⁴、Q、X及びZは、請求項1から8のいずれかに定義されているとおりであり、R⁵は、ハロゲン又はCNであり、

PGは、

C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シルクロアルキル-C₁-C₄-アルキル、C₅-C₆-シクロアルケニル、テトラヒドロピラニル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル、ホルミル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル、C₁-C₆-アルキル-O-カルボニル、C₂-C₆-アルケニル-O-カルボニル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル-C₁-C₄-アルキル、フェニル-C₁-C₄-アルキル、フェニルチオ-C₁-C₆-アルキル、及びフェニルカルボニルからなる群から選択される保護基であり、

フェニル環はそれぞれ、ハロゲン、CN、NO₂、C₁-C₄-アルキル及びC₁-C₄-アルコキシからなる群から選択される1～3個の置換基により置換されていてもよく、

I²は、Hであり、

I³は、H又はC(=Y)L²であり、

Yは、O又はSであり、

L²は、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ又はアリールオキシ(アリール部分は、それ自体、部分的に若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、並びに/又はシアノ、ニトロ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-アルキルチオからなる群からの1～3個の置換基により置換されていてもよい)であるか、

又はI²とI³は、それらが結合しているN原子と一緒にになって、基「YCN」(YはO又はSである)、

又は基「PGN」(これは、C₁-C₆-アルキル-O(CO)NH-、フルオレニルメチル-O(CO)NH-、H(CO)NH-、C₁-C₆-アルキル-(CO)-NH-、C₁-C₆-ハロアルキル-(CO)-NH-、N-フタルイミド、フェニル-O(CO)NH-、フェニル-C₁-C₄-アルキル-O(CO)NH-、フェニル-C₁-C₄-アルキル-NH-、及びジ(フェニル-C₁-C₄-アルキル)N-(フェニル環はそれぞれ、1～3個のC₁-C₄-アルコキシ置換基により置換されていてもよい)からなる群から選択される、保護アミン置換基である)を形成する]

の中間体(それらの塩を含む)。

【請求項 1 3】

除草活性量の少なくとも1種の請求項1に記載される式(I)のウラシルピリジン、並びに少なくとも1種の不活性液体担体及び/又は不活性固体担体、並びに適切である場合、少なくとも1種の界面活性物質を含む除草組成物。

【請求項 1 4】

除草活性量の少なくとも1種の請求項1に記載の式(I)のウラシルピリジン、並びに少なくとも1種の不活性液体担体及び/又は不活性固体担体、並びに所望の場合、少なくとも1種

20

30

40

50

の界面活性物質を混合するステップを含む除草活性組成物の調製方法。

【請求項 15】

除草活性量の少なくとも1種の請求項1に記載の式(I)のウラシルピリジンを、植物、それらの環境又は種子に作用させるステップを含む、望ましくない植生を防除する方法。

【請求項 16】

除草剤としての、請求項1に記載の式(I)のウラシルピリジンの使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、以下に定義されている一般式(I)のウラシルピリジン及び除草剤としてのそれらの使用に関する。さらに、本発明は、作物保護のための組成物及び不要な植生を防除する方法に関する。

10

【背景技術】

【0002】

WO 02/098227及びWO 11/137088は、構造的に類似した化合物を記載しており、この化合物は、とりわけウラシルがフェニルにより置換されているという点で、本発明によるウラシルピリジン(I)とは異なり、他方、本発明によるウラシルは、ピリジルにより置換されている。

【0003】

しかし、有害植物に関するこれらの既知の化合物の除草特性は、必ずしも完全に満足いくものであるとは限らない。

20

【先行技術文献】

【特許文献】

【0004】

【文献】WO 02/098227

WO 11/137088

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0005】

従って、本発明の目的は、改善された除草作用を有する式(I)のウラシルピリジンを提供することである。特に、特に低施用量でさえも高い除草活性を有し、かつ商業的利用のための作物植物に十分に適合する、式(I)のウラシルピリジンを提供することである。

30

【0006】

これらの及びさらなる目的は、以下に定義される式(I)のウラシルピリジン、またそれらの農業上好適な塩によって達成される。

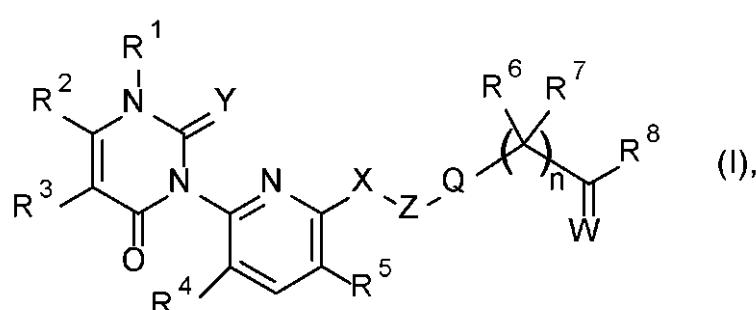
【課題を解決するための手段】

【0007】

従って、本発明は、式(I)

【0008】

【化1】



[式中、置換基は以下の意味を有する:

50

R¹は、水素、NH₂、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-アルキニルであり；

R²は、水素、C₁-C₆-アルキル又はC₁-C₆-ハロアルキルであり；

R³は、水素又はC₁-C₆-アルキルであり；

R⁴は、H又はハロゲンであり；

R⁵は、ハロゲン、CN、NO₂、NH₂、CF₃又はC(=S)NH₂であり；

R⁶は、H、ハロゲン、CN、C₁-C₃-アルキル、C₁-C₃-ハロアルキル、C₁-C₃-アルコキシ、C₁-C₃-ハロアルコキシ、C₁-C₃-アルキルチオ、(C₁-C₃-アルキル)アミノ、ジ(C₁-C₃-アルキル)アミノ、C₁-C₃-アルコキシ-C₁-C₃-アルキル、C₁-C₃-アルコキシカルボニルであり；

R⁷は、H、ハロゲン、C₁-C₃-アルキル、C₁-C₃-アルコキシであり；

R⁸は、OR⁹、SR⁹、NR¹⁰R¹¹、NR⁹OR⁹、NR⁹S(O)₂R¹⁰又はNR⁹S(O)₂NR¹⁰R¹¹であり；

R⁹は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₆-ハロアルケニル、C₃-C₆-ハロアルキニル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルコキシ)C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ハロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルホニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルキニルオキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルキル、アミノ、(C₁-C₆-アルキル)アミノ、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ、(C₁-C₆-アルキルカルボニル)アミノ、アミノ-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、

-N=CR¹²R¹³(R¹²及びR¹³は、互いに独立して、H、C₁-C₄-アルキル又はフェニルである)；

C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ヘテロシクリル、C₃-C₆-ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル、フェニル、フェニル-C₁-C₄-アルキル又は5若しくは6員のヘテロアリールであり；

シクロアルキル環、ヘテロシクリル環、フェニル環又はヘテロアリール環はそれれ、R¹⁴から選択される1～4個の置換基又は3～7員の炭素環(carbocyclicus)により置換されていてもよく、

この炭素環は、炭素原子に加えて、-N(R¹²)-、-N=N-、-C(=O)-、-O-及び-S-からなる群から選択される1又は2個の環員を場合により有しており、

この炭素環は、R¹⁴から選択される1～4個の置換基により場合により置換されており；

R¹⁴は、ハロゲン、NO₂、CN、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ又はC₁-C₄-アルコキシカルボニルであり；

R¹⁰、R¹¹は、互いに独立して、R⁹であるか、又は一緒になって3～7員の炭素環を形成し、

この炭素環は、炭素原子に加えて、-N(R¹²)-、-N=N-、-C(=O)-、-O-及び-S-からなる群から選択される1又は2個の環員を場合により有しており、

この炭素環は、R¹⁴から選択される1～4個の置換基により場合により置換されており；

nは、1～3であり；

Qは、CH₂、O、S、SO、SO₂、NH又は(C₁-C₃-アルキル)Nであり；

Wは、O又はSであり；

10

20

30

40

50

Xは、NH、NCH₃、O又はSであり；

Yは、O又はSであり；

Zは、それぞれ、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシからなる群から選択される、1~4個の置換基により場合により置換されている、フェニル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル又はピラジニルである】

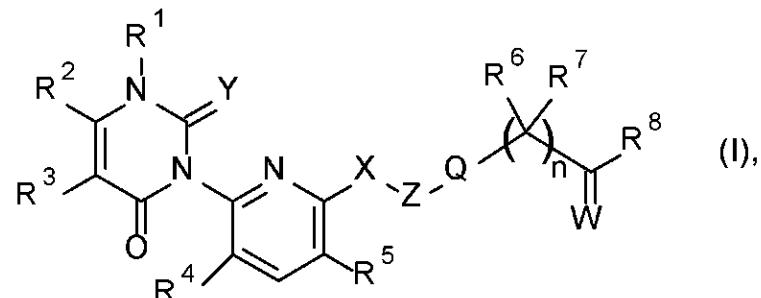
で表されるウラシルピリジン(それらの農業上許容可能な塩又は誘導体を含む)であって、但し、式(I)の化合物がカルボキシル基を有することを条件とする、ウラシルピリジンを提供する。

【0009】

本発明はまた、式(I)

【0010】

【化2】



[式中、置換基は以下の意味を有する：

R¹は、水素、NH₂、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-アルキニルであり；

R²は、水素、C₁-C₆-アルキル又はC₁-C₆-ハロアルキルであり；

R³は、水素又はC₁-C₆-アルキルであり；

R⁴は、H又はハロゲンであり；

R⁵は、ハロゲン、CN、NO₂、NH₂、CF₃又はC(=S)NH₂であり；

R⁶は、H、ハロゲン、CN、C₁-C₃-アルキル、C₁-C₃-ハロアルキル、C₁-C₃-アルコキシ、C₁-C₃-ハロアルコキシ、C₁-C₃-アルキルチオ、(C₁-C₃-アルキル)アミノ、ジ(C₁-C₃-アルキル)アミノ、C₁-C₃-アルコキシカルボニルであり；

R⁷は、H、ハロゲン、C₁-C₃-アルキル、C₁-C₃-アルコキシであり；

R⁸は、OR⁹、SR⁹、NR¹⁰R¹¹、NR⁹OR⁹、NR⁹S(O)₂R¹⁰又はNR⁹S(O)₂NR¹⁰R¹¹であり；

R⁹は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₆-ハロアルケニル、C₃-C₆-ハロアルキニル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルコキシ)C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ハロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルホニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルキニルオキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、アミノ、(C₁-C₆-アルキル)アミノ、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ、(C₁-C₆-アルキルカルボニル)アミノ、アミノ-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、

10

20

30

40

50

$-N=CR^{12}R^{13}$ (R^{12} 及び R^{13} は、互いに独立して、H、C₁-C₄-アルキル又はフェニルである)、

C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ヘテロシクリル、C₃-C₆-ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル、フェニル、フェニル-C₁-C₄-アルキル又は5若しくは6員のヘテロアリールであり、

シクロアルキル環、ヘテロシクリル環、フェニル環又はヘテロアリール環はそれぞれ、R¹⁴から選択される1~4個の置換基又は3~7員の炭素環により置換されていてもよく、

この炭素環は、炭素原子に加えて、-N(R¹²)-、-N=N-、-C(=O)-、-O-及び-S-からなる群から選択される1又は2個の環員を場合により有しており、

この炭素環は、R¹⁴から選択される1~4個の置換基により場合により置換されており；

R¹⁴は、ハロゲン、NO₂、CN、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ又はC₁-C₄-アルコキシカルボニルであり；

R¹⁰、R¹¹は、互いに独立して、R⁹であるか、又は一緒になって3~7員の炭素環を形成し、

この炭素環は、炭素原子に加えて、-N(R¹²)-、-N=N-、-C(=O)-、-O-及び-S-からなる群から選択される1又は2個の環員を場合により有しており、

この炭素環は、R¹⁴から選択される1~4個の置換基により場合により置換されており；

nは、1~3であり；

Qは、O、S、SO、SO₂、NH又は(C₁-C₃-アルキル)Nであり；

Wは、O又はSであり；

Xは、O又はSであり；

Yは、O又はSであり；

Zは、それぞれ、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシからなる群から選択される、1~4個の置換基により場合により置換されている、フェニル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル又はピラジニルである】

で表されるウラシルピリジン(それらの農業上許容可能な塩又は誘導体を含む)

であって、但し、式(I)の化合物がカルボキシル基を有することを条件とする、ウラシルピリジンを提供する。

【0011】

本発明はまた、少なくとも1種の式(I)のウラシルピリジンと作物保護剤の製剤化に慣用の助剤とを含む農薬組成物にも関する。

【0012】

本発明はまた、少なくとも1種の式(I)のウラシルピリジン(成分A)、並びに除草化合物B(成分B)及び薬害軽減剤C(成分C)から選択される、少なくとも1種のさらなる化合物を含む、除草組成物を提供する。

【0013】

本発明はまた、除草剤としての、すなわち有害植物を防除するための、式(I)のウラシルピリジンの使用を提供する。

【0014】

本発明さらに、不要な植生を防除する方法であって、除草有効量の少なくとも1種の式(I)のウラシルピリジンを、植物、それらの種子及び/又はそれらの生息地に作用させる方法をさらに提供する。施用は、望ましくない植物の出芽の前、最中及び/又は後に、好ましくは最中及び/又は後に行うことができる。

【0015】

さらに、本発明は、式(I)のウラシルピリジンを製造するための方法及び中間体に関する。

10

20

30

40

50

【図面の簡単な説明】

【0016】

【図1】図1はPXRDパターンを示す。

【発明を実施するための形態】

【0017】

本発明のさらなる実施形態は、特許請求の範囲、明細書及び実施例から明らかである。上記の及び以下にさらに示される本発明の主題の特徴は、各特定の場合において記載される組合せにおいてのみならず、他の組合せにおいても本発明の範囲を逸脱することなく適用され得ることが理解されよう。

【0018】

本明細書中で使用される用語「防除する」と「駆除する」とは同義語である。

【0019】

本明細書中で使用される用語「望ましくない植生」及び「有害植物」は同義語である。

【0020】

本明細書に記載される、式(I)のウラシルピリジン、除草化合物B及び/又は薬害軽減剤Cが、幾何異性体(例えばE/Z異性体)を形成し得る場合、本発明による組成物において、純粋な異性体及びそれらの混合物の両方を使用することが可能である。

【0021】

本明細書に記載される、式(I)のウラシルピリジン、除草化合物B及び/又は薬害軽減剤Cが、1つ以上のキラル中心を有し、その結果、エナンチオマー又はジアステレオマーとして存在する場合、本発明による組成物において、純粋なエナンチオマー及びジアステレオマー並びにそれらの混合物の両方を、使用することが可能である。

【0022】

式(I)のウラシルピリジンの置換基内に、水素の代わりに、対応する同位体である重水素も使用することができる。

【0023】

本明細書中に記載される、式(I)のウラシルピリジン、除草化合物B及び/又は薬害軽減剤Cが、イオン化可能な官能基を有する場合、これらは、それらの農業上許容可能な塩の形態で用いることもできる。好適なのは、一般的に、そのカチオン及びアニオンが、それぞれ活性化合物の活性に悪影響を及ぼさないようなカチオンの塩及び酸の酸付加塩である。

【0024】

好ましいカチオンは、アルカリ金属のイオン(好ましくはリチウム、ナトリウム及びカリウムのイオン)、アルカリ土類金属のイオン(好ましくはカルシウム及びマグネシウムのイオン)、並びに遷移金属のイオン(好ましくはマンガン、銅、亜鉛及び鉄のイオン)、さらにアンモニウム、及び1~4個の水素原子がC₁-C₄-アルキル、ヒドロキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、ヒドロキシ-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、フェニル又はベンジルで置換されている置換アンモニウム(好ましくはアンモニウム、メチルアンモニウム、イソプロピルアンモニウム、ジメチルアンモニウム、ジエチルアンモニウム、ジイソプロピルアンモニウム、トリメチルアンモニウム、トリエチルアンモニウム、トリス(イソプロピル)アンモニウム、ヘプチルアンモニウム、ドデシルアンモニウム、テトラデシルアンモニウム、テトラメチルアンモニウム、テトラエチルアンモニウム、テトラブチルアンモニウム、2-ヒドロキシエチルアンモニウム(オールアミン塩)、2-(2-ヒドロキシエタ-1-オキシ)エタ-1-イルアンモニウム(ジグリコールアミン塩)、ジ(2-ヒドロキシエタ-1-イル)-アンモニウム(ジオールアミン塩)、トリス(2-ヒドロキシエチル)アンモニウム(トロールアミン塩)、トリス(2-ヒドロキシプロピル)アンモニウム、ベンジルトリメチルアンモニウム、ベンジルトリエチルアンモニウム、N,N,N-トリメチルエタノールアンモニウム(コリン塩))、さらにはホスホニウムイオン、スルホニウムイオン、好ましくはトリ(C₁-C₄-アルキル)スルホニウム(例えばトリメチルスルホニウム)、及びスルホキソニウムイオン、好ましくはトリ(C₁-C₄-アルキル)スルホキソニウム、最後にポリ塩基性アミン(例えばN,N-ビス-(3-アミノプロピル)メチルアミン及びジエチレントリアミン)の塩である。

10

20

30

40

50

【0025】

同様に好ましいカチオンは、アルカリ金属のイオン(好ましくはリチウム、ナトリウム及びカリウムのイオン)、アルカリ土類金属のイオン(好ましくはカルシウム及びマグネシウムのイオン)、並びに遷移金属のイオン(好ましくはマンガン、銅、亜鉛及び鉄のイオン)、さらにアンモニウム、及び1~4個の水素原子がC₁-C₄-アルキル、ヒドロキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、ヒドロキシ-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、フェニル又はベンジルで置換されている置換アンモニウム(好ましくはアンモニウム、メチルアンモニウム、イソプロピルアンモニウム、ジメチルアンモニウム、ジイソプロピルアンモニウム、トリメチルアンモニウム、ヘプチルアンモニウム、ドデシルアンモニウム、テトラデシルアンモニウム、テトラメチルアンモニウム、テトラエチルアンモニウム、テトラブチルアンモニウム、2-ヒドロキシエチル-アンモニウム(オールアミン塩)、2-(2-ヒドロキシエタ-1-オキシ)エタ-1-イルアンモニウム(ジグリコールアミン塩)、ジ(2-ヒドロキシエタ-1-イル)-アンモニウム(ジオールアミン塩)、トリス(2-ヒドロキシエチル)アンモニウム(トロールアミン塩)、トリス(2-ヒドロキシプロピル)アンモニウム、ベンジルトリメチルアンモニウム、ベンジルトリエチルアンモニウム、N,N,N-トリメチルエタノールアンモニウム(コリン塩))、さらにはホスホニウムイオン、スルホニウムイオン、好ましくはトリ(C₁-C₄-アルキル)スルホニウム(例えばトリメチルスルホニウム)、及びスルホキソニウムイオン、好ましくはトリ(C₁-C₄-アルキル)スルホキソニウム、最後にポリ塩基性アミン(例えばN,N-ビス-(3-アミノプロピル)メチルアミン及びジエチレントリアミン)の塩である。

【0026】

有用な酸付加塩のアニオンは、主に塩素イオン、臭素イオン、フッ素イオン、ヨウ素イオン、硫酸水素イオン、硫酸メチルイオン、硫酸イオン、リン酸二水素イオン、リン酸水素イオン、硝酸イオン、重炭酸イオン、炭酸イオン、ヘキサフルオロケイ酸イオン、ヘキサフルオリン酸イオン、安息香酸イオン、さらにまたC₁-C₄-アルカン酸のアニオン、好ましくはギ酸イオン、酢酸イオン、プロピオン酸イオン及び酪酸イオンである。

【0027】

本明細書に記載される、カルボキシル基を有する、式(I)のウラシルピリジン、除草化合物B及び/又は薬害軽減剤Cは、酸の形態、上記の農業上好適な塩の形態、又は他には、農業上許容可能な誘導体の形態で、例えば、アミド(例えばモノ及びジ-C₁-C₆-アルキルアミド又はアリールアミド)として、エステルとして(例えばアリルエステル、プロパルギルエステル、C₁-C₁₀-アルキルエステル、アルコキシアルキルエステル、テフリル((テトラヒドロフラン-2-イル)メチル)エステルとして)、及びまたチオエステルとして(例えばC₁-C₁₀-アルキルチオエステルとして)使用することができる。好ましいモノ及びジ-C₁-C₆-アルキルアミドは、メチル及びジメチルアミドである。好ましいアリールアミドは、例えば、アニリド及び2-クロロアニリドである。好ましいアルキルエステルは、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、ペンチル、メキシル(1-メチルヘキシル)、メブチル(1-メチルヘブチル)、ヘブチル、オクチル又はイソオクチル(2-エチルヘキシル)エステルである。好ましいC₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキルエステルは、直鎖又は分岐鎖C₁-C₄-アルコキシエチルエステル、例えば2-メトキシエチル、2-エトキシエチル、2-ブトキシエチル(ブチル)、2-ブトキシプロピル又は3-ブトキシプロピルエステルである。直鎖又は分岐鎖C₁-C₁₀-アルキルチオエステルの一例は、エチルチオエステルである。

【0028】

可変要素R¹~R¹⁴及びR^a~R^eの定義において言及される有機部分は、用語「ハロゲン」のように、個々の基員の個別の列挙の総称である。用語「ハロゲン」は、いずれの場合も、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を表す。全ての炭化水素鎖、すなわち全てのアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ鎖は、直鎖であっても分岐鎖であってもよく、接頭辞C_n-C_mは、いずれの場合も基中の可能な炭素原子の数を表す。

【0029】

10

20

30

40

50

このような意味の例は以下のとおりである:

- C₁-C₃-アルキル、及びまたジ(C₁-C₃-アルキル)アミノ、C₁-C₃-アルコキシ-C₁-C₃-アルキルのC₁-C₃-アルキル部分:例えばCH₃、C₂H₅、n-プロピル及びCH(CH₃)₂;
- C₁-C₄-アルキル、及びまたフェニル-C₁-C₄-アルキルのC₁-C₄-アルキル部分:例えばCH₃、C₂H₅、n-プロピル、CH(CH₃)₂、n-ブチル、CH(CH₃)-C₂H₅、CH₂-CH(CH₃)₂及びC(CH₃)₃;
- C₁-C₆-アルキル、及びまたC₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-アルキルオキシ(alkyoxy)-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルコキシ)C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ハロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルホニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルキニルオキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキルカルボニル)アミノ、アミノ-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキルのC₁-C₆-アルキル部分:上記のC₁-C₄-アルキル、及びまた例えばn-ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2,2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、n-ヘキシル、1,1-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル又は1-エチル-2-メチルプロピル、好ましくはメチル、エチル、n-プロピル、1-メチルエチル、n-ブチル、1,1-ジメチルエチル、n-ペンチル又はn-ヘキシル;
- C₁-C₃-ハロアルキル:フッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素により部分的に又は完全に置換されている上記のC₁-C₃-アルキル、例えばクロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、プロモメチル、ヨードメチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、2-ヨードエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチル、2,2-ジクロロ-2-フルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、2-フルオロプロピル、3-フルオロプロピル、2,2-ジフルオロプロピル、2,3-ジフルオロプロピル、2-クロロプロピル、3-クロロプロピル、2,3-ジクロロプロピル、2-ブロモプロピル、3-ブロモプロピル、3,3,3-トリフルオロプロピル、3,3,3-トリクロロプロピル、2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロピル、ヘptaフルオロプロピル、1-(フルオロメチル)-2-フルオロエチル、1-(クロロメチル)-2-クロロエチル、1-(ブロモメチル)-2-ブロモエチル;
- C₁-C₄-ハロアルキル:フッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素により部分的に又は完全に置換されている上記のC₁-C₄-アルキル、例えばクロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、プロモメチル、ヨードメチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、2-ヨードエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチル、2,2-ジクロロ-2-フルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、2-フルオロプロピル、3-フルオロプロピル、2,2-ジフルオロプロピル、2,3-ジフルオロプロピル、2-クロロプロピル、3-クロロプロピル、2,3-ジクロロプロピル、2-ブロモプロピル、3-ブロモプロピル、3,3,3-トリフルオロプロピル、3,3,3-トリクロロプロピル、2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロピル、ヘptaフルオロプロピル、1-(フルオロメチル)-2-フルオロエチル、1-(クロロメチル)-2-クロロエチル、1-(ブロモメチル)-2-ブロモエチル;

10

20

30

40

50

ロモプロピル、3-プロモプロピル、3,3,3-トリフルオロプロピル、3,3,3-トリクロロプロピル、2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、1-(フルオロメチル)-2-フルオロエチル、1-(クロロメチル)-2-クロロエチル、1-(プロモメチル)-2-プロモエチル、4-フルオロブチル、4-クロロブチル、4-プロモブチル、ノナフルオロブチル、1,1,2,2,-テトラフルオロエチル及び1-トリフルオロメチル-1,2,2,2-テトラフルオロエチル;

- C₁-C₆-ハロアルキル:上記のC₁-C₄-ハロアルキル、及びまた例えれば、5-フルオロペンチル、5-クロロペンチル、5-プロモペンチル、5-ヨードペンチル、ウンデカフルオロペンチル、6-フルオロヘキシル、6-クロロヘキシル、6-プロモヘキシル、6-ヨードヘキシル及びドデカフルオロヘキシル;

- C₃-C₆-アルケニル、及びまたC₃-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシカルボニル-C₁-C₆-アルキルのC₃-C₆-アルケニル部分:例えれば1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチルエテニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-1-ブテニル、2-メチル-1-ブテニル、3-メチル-1-ブテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1,1-ジメチル-2-プロペニル、1,2-ジメチル-1-プロペニル、1,2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-1-ペンテニル、2-メチル-1-ペンテニル、3-メチル-1-ペンテニル、4-メチル-1-ペンテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1,1-ジメチル-2-ブテニル、1,1-ジメチル-3-ブテニル、1,2-ジメチル-1-ブテニル、1,2-ジメチル-2-ブテニル、1,2-ジメチル-3-ブテニル、1,3-ジメチル-1-ブテニル、1,3-ジメチル-2-ブテニル、1,3-ジメチル-3-ブテニル、2,2-ジメチル-3-ブテニル、2,3-ジメチル-1-ブテニル、2,3-ジメチル-2-ブテニル、2,3-ジメチル-3-ブテニル、3,3-ジメチル-1-ブテニル、3,3-ジメチル-2-ブテニル、1-エチル-1-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-1-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1,1,2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、1-エチル-2-メチル-1-プロペニル及び1-エチル-2-メチル-2-プロペニル;

- C₃-C₆-ハロアルケニル、及びまたC₃-C₆-ハロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキルのC₃-C₆-ハロアルケニル部分:フッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素により部分的に又は完全に置換されている上記のC₃-C₆-アルケニル基、例えは2-クロロプロパ-2-エン-1-イル、3-クロロプロパ-2-エン-1-イル、2,3-ジクロロプロパ-2-エン-1-イル、3,3-ジクロロプロパ-2-エン-1-イル、2,3,3-トリクロロ-2-エン-1-イル、2,3-ジクロロブタ-2-エン-1-イル、2-ブロモプロパ-2-エン-1-イル、3-ブロモプロパ-2-エン-1-イル、2,3-ジブロモプロパ-2-エン-1-イル、3,3-ジブロモプロパ-2-エン-1-イル、2,3,3-トリブロモ-2-エン-1-イル又は2,3-ジブロモブタ-2-エン-1-イル;

- C₃-C₆-アルキニル、及びまたC₃-C₆-アルキニルオキシカルボニル-C₁-C₆-アルキルのC₃-C₆-アルキニル部分:例えは、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、3-メチル-1-ブチニル、1,1-ジメチル-2-プロピニル、1-エチル-2-プロピニル、1-ヘキシニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニル、1-メチル-2-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-1-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-1-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニル、1,1-ジメチル-2-ブチニル、1,1-ジメチル-3-ブチニル、1,2-ジメチル-3-ブチニル、2,2-ジメチル-3-ブチニル、3,3-ジメチル-1-ブチニル、1-エチル-2-ブ

10

20

30

40

50

チニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル及び1-エチル-1-メチル-2-プロピニル；

- C₃-C₆-ハロアルキニル:フッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素により部分的に又は完全に置換されている、上記のC₃-C₆-アルキニル基、例えば1,1-ジフルオロプロパ-2-イン-1-イル、3-クロロプロパ-2-イン-1-イル、3-ブロモプロパ-2-イン-1-イル、3-ヨードプロパ-2-イン-1-イル、4-フルオロブタ-2-イン-1-イル、4-クロロブタ-2-イン-1-イル、1,1-ジフルオロブタ-2-イン-1-イル、4-ヨードブタ-3-イン-1-イル、5-フルオロペンタ-3-イン-1-イル、5-ヨードペンタ-4-イン-1-イル、6-フルオロヘキサ-4-イン-1-イル又は6-ヨードヘキサ-5-イン-1-イル；

- C₁-C₃-アルコキシ、及びまたC₁-C₃-アルコキシ-C₁-C₃-アルキル、C₁-C₃-アルコキシカルボニルのC₁-C₃-アルコキシ部分:例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ；

- C₁-C₄-アルコキシ、及びまたC₁-C₄-アルコキシカルボニルのC₁-C₄-アルコキシ部分:例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、1-メチルエトキシプロキシ、1-メチルプロポキシ、2-メチルプロポキシ及び1,1-ジメチルエトキシ；

- C₁-C₆-アルコキシ、及びまたC₁-C₆-アルキオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルコキシ)C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキルのC₁-C₆-アルコキシ部分:上記のC₁-C₄-アルコキシ、及びまた例えば、ペントキシ、1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メトキシルブトキシ、1,1-ジメチルブロポキシ、1,2-ジメチルブロポキシ、2,2-ジメチルブロポキシ、1-エチルブロポキシ、ヘキソキシ、1-メチルペントキシ、2-メチルペントキシ、3-メチルペントキシ、4-メチルペントキシ、1,1-ジメチルブトキシ、1,2-ジメチルブトキシ、1,3-ジメチルブトキシ、2,2-ジメチルブトキシ、2,3-ジメチルブトキシ、3,3-ジメチルブトキシ、1-エチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1,1,2-トリメチルブロポキシ、1,2,2-トリメチルブロポキシ、1-エチル-1-メチルブロポキシ及び1-エチル-2-メチルブロポキシ；

- C₁-C₃-ハロアルコキシ:フッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素により部分的に又は完全に置換されている上記のC₁-C₃-アルコキシ基、すなわち、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、クロロジフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブロモメトキシ、2-ヨードエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2-フルオロエトキシ、2,2-ジクロロ-2-フルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、2-フルオロブロポキシ、3-フルオロブロポキシ、2-クロロブロポキシ、3-クロロブロポキシ、2-ブロモブロポキシ、3-ブロモブロポキシ、2,2-ジフルオロブロポキシ、2,3-ジフルオロブロポキシ、2,3-ジクロロブロポキシ、3,3,3-トリフルオロブロポキシ、3,3,3-トリクロロブロポキシ、2,2,3,3,3-ペンタフルオロブロポキシ、ヘプタフルオロブロポキシ、1-(フルオロメチル)-2-フルオロエトキシ、1-(クロロメチル)-2-クロロエトキシ、1-(ブロモメチル)-2-ブロモエトキシ；

- C₁-C₄-ハロアルコキシ:フッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素により部分的に又は完全に置換されている上記のC₁-C₄-アルコキシ基、すなわち、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、クロロジフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブロモメトキシ、2-ヨードエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2-フルオロエトキシ、2,2-ジクロロ-2-フルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、2-フルオロブロポキシ、3-フルオロブロポキシ、2-クロロブロポキシ、3-クロロブロポキシ、2-ブロモブロポキシ、3-ブロモブロポキシ、2,2-ジフルオロブロポキシ、2,3-ジフルオロブロポキシ、2,3-ジクロロブロポキシ、3,3,3-トリフルオロブロポキシ、3,3,3-トリクロロブロポキシ、2,2,3,3,3-ペンタフルオロブロポキシ、ヘプタフルオロブロポキシ、1-(フルオロメチル)-2-フルオロエトキシ、1-(クロロメチル)-2-クロロエトキシ、1-(ブロモメチル)-2-ブロモエトキシ、4-フルオロブトキシ、4-クロロブトキシ、4-ブロモブトキシ及びノナフルオロブトキシ；

10

20

30

40

50

- C₁-C₆-ハロアルコキシ、及びまたC₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキルのC₁-C₆-ハロアルコキシ部分:上記のC₁-C₄-ハロアルコキシ、及びまた例えば、5-フルオロペントキシ、5-クロロペントキシ、5-ブロモペントキシ、5-ヨードペントキシ、ウンデカフルオロペントキシ、6-フルオロヘキソキシ、6-クロロヘキソキシ、6-ブロモヘキソキシ、6-ヨードヘキソキシ及びドデカフルオロヘキソキシ;

- C₁-C₃-アルキルチオ:例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、1-メチルエチルチオ;

- C₁-C₄-アルキルチオ:例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、1-メチルエチルチオ、ブチルチオ、1-メチルプロピルチオ、2-メチルプロピルチオ及び1,1-ジメチルエチルチオ;

- C₁-C₆-アルキルチオ、及びまたC₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルキルのC₁-C₆-アルキルチオ部分:上記のC₁-C₄-アルキルチオ、及びまた例えばペンチルチオ、1-メチルブチルチオ、2-メチルブチルチオ、3-メチルブチルチオ、2,2-ジメチルプロピルチオ、1-エチルプロピルチオ、ヘキシルチオ、1,1-ジメチルプロピルチオ、1,2-ジメチルプロピルチオ、1-メチルペンチルチオ、2-メチルペンチルチオ、3-メチルペンチルチオ、4-メチルペンチルチオ、1,1-ジメチルブチルチオ、1,2-ジメチルブチルチオ、1,3-ジメチルブチルチオ、2,2-ジメチルブチルチオ、2,3-ジメチルブチルチオ、3,3-ジメチルブチルチオ、1-エチルブチルチオ、2-エチルブチルチオ、1,1,2-トリメチルプロピルチオ、1,2,2-トリメチルプロピルチオ、1-エチル-1-メチルプロピルチオ及び1-エチル-2-メチルプロピルチオ;

- C₁-C₆-アルキルスルフィニル(C₁-C₆-アルキル-S(=O)-)、及びまたC₁-C₆-アルキルスルフィニル-C₁-C₆-アルキルのC₁-C₆-アルキルスルフィニル部分: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、1-メチルエチルスルフィニル、ブチルスルフィニル、1-メチルプロピルスルフィニル、2-メチルプロピルスルフィニル、1,1-ジメチルエチルスルフィニル、ベンチルスルフィニル、1-メチルブチルスルフィニル、2-メチルブチルスルフィニル、3-メチルブチルスルフィニル、2,2-ジメチルプロピルスルフィニル、1-エチルプロピルスルフィニル、1,1-ジメチルプロピルスルフィニル、1,2-ジメチルプロピルスルフィニル、ヘキシルスルフィニル、1-メチルペンチルスルフィニル、2-メチルペンチルスルフィニル、3-メチルペンチルスルフィニル、4-メチルペンチルスルフィニル、1,1-ジメチルブチルスルフィニル、1,2-ジメチルブチルスルフィニル、1,3-ジメチルブチルスルフィニル、2,2-ジメチルブチルスルフィニル、2,3-ジメチルブチルスルフィニル、3,3-ジメチルブチルスルフィニル、1-エチルブチルスルフィニル、2-エチルブチルスルフィニル、1,1,2-トリメチルプロピルスルフィニル、1,2,2-トリメチルプロピルスルフィニル、1-エチル-1-メチルプロピルスルフィニル及び1-エチル-2-メチルプロピルスルフィニル;

- C₁-C₆-アルキルスルホニル(C₁-C₆-アルキル-S(O)₂-)、及びまたC₁-C₆-アルキルスルホニル-C₁-C₆-アルキルのC₁-C₆-アルキルスルホニル部分: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、1-メチルエチルスルホニル、ブチルスルホニル、1-メチルプロピルスルホニル、2-メチル-プロピルスルホニル、1,1-ジメチルエチルスルホニル、ベンチルスルホニル、1-メチルブチルスルホニル、2-メチルブチルスルホニル、3-メチルブチルスルホニル、1,1-ジメチルプロピルスルホニル、1,2-ジメチルプロピルスルホニル、2,2-ジメチルプロピルスルホニル、1-エチルプロピルスルホニル、ヘキシルスルホニル、1-メチルペンチルスルホニル、2-メチルペンチルスルホニル、3-メチルペンチルスルホニル、4-メチルペンチルスルホニル、1,1-ジメチルブチルスルホニル、1,2-ジメチルブチルスルホニル、1,3-ジメチルブチルスルホニル、2,2-ジメチルブチルスルホニル、2,3-ジメチルブチルスルホニル、3,3-ジメチルブチルスルホニル、1-エチルブチルスルホニル、2-エチルブチルスルホニル、1,1,2-トリメチル-プロピルスルホニル、1,2,2-トリメチルプロピルスルホニル、1-エチル-1-メチルプロピルスルホニル及び1-エチル-2-メチルプロピルスルホニル;

- (C₁-C₃-アルキル)アミノ:例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、1-

10

20

30

40

50

メチルエチルアミノ；

- (C₁-C₄-アルキル)アミノ: 例えばメチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、1-メチルエチルアミノ、ブチルアミノ、1-メチルプロピルアミノ、2-メチルプロピルアミノ又は1,1-ジメチルエチルアミノ；

- (C₁-C₆-アルキル)アミノ: 上記の(C₁-C₄-アルキルアミノ)、及びまた例えば、ペンチルアミノ、1-メチルブチルアミノ、2-メチルブチルアミノ、3-メチルブチルアミノ、2,2-ジメチルプロピルアミノ、1-エチルプロピルアミノ、ヘキシルアミノ、1,1-ジメチルプロピルアミノ、1,2-ジメチルプロピルアミノ、1-メチルペンチルアミノ、2-メチルペンチルアミノ、3-メチルペンチルアミノ、4-メチルペンチルアミノ、1,1-ジメチルブチルアミノ、1,2-ジメチルブチルアミノ、1,3-ジメチルブチルアミノ、2,2-ジメチルブチルアミノ、2,3-ジメチルブチルアミノ、3,3-ジメチルブチルアミノ、1-エチルブチルアミノ、2-エチルブチルアミノ、1,1,2-トリメチルプロピルアミノ、1,2,2-トリメチル-プロピルアミノ、1-エチル-1-メチルプロピルアミノ又は1-エチル-2-メチルプロピルアミノ；

- ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ: 上記のジ(C₁-C₄-アルキル)アミノ、及びまた例えばN-メチル-N-ペンチルアミノ、N-メチル-N-(1-メチルブチル)アミノ、N-メチル-N-(2-メチルブチル)アミノ、N-メチル-N-(3-メチルブチル)アミノ、N-メチル-N-(2,2-ジメチルプロピル)アミノ、N-メチル-N-(1-エチルプロピル)アミノ、N-メチル-N-ヘキシルアミノ、N-メチル-N-(1,1-ジメチルブチル)アミノ、N-メチル-N-(1,2-ジメチルブチル)アミノ、N-メチル-N-(1,3-ジメチルブチル)アミノ、N-メチル-N-(2,2-ジメチルブチル)アミノ、N-メチル-N-(2,3-ジメチルブチル)アミノ、N-メチル-N-(3,3-ジメチルブチル)アミノ、N-メチル-N-(1-エチルブチル)アミノ、N-メチル-N-(2-エチルブチル)アミノ、N-メチル-N-(1,1,2-トリメチルプロピル)アミノ、N-メチル-N-(1-エチル-1-メチルプロピル)アミノ、N-メチル-N-(1-エチル-2-メチルプロピル)アミノ、N-エチル-N-ペンチルアミノ、N-エチル-N-(1-メチルブチル)アミノ、N-エチル-N-(2-メチルブチル)アミノ、N-エチル-N-(3-メチルブチル)アミノ、N-エチル-N-(4-メチルペンチル)アミノ、N-エチル-N-(1,1-ジメチルブチル)アミノ、N-エチル-N-(1,2-ジメチルブチル)アミノ、N-エチル-N-(1,3-ジメチルブチル)アミノ、N-エチル-N-(2,2-ジメチルブチル)アミノ、N-エチル-N-(2,3-ジメチルブチル)アミノ、N-エチル-N-(3,3-ジメチルブチル)アミノ、N-エチル-N-(1-エチルブチル)アミノ、N-エチル-N-(2-エチルブチル)アミノ、N-エチル-N-(1,1,2-トリメチルプロピル)アミノ、N-エチル-N-(1,2,2-トリメチルプロピル)アミノ、N-エチル-N-(1-エチル-1-メチルプロピル)アミノ、N-エチル-N-(1-エチル-2-メチルプロピル)アミノ、N-プロピル-N-ペンチルアミノ、N-ブチル-N-ペンチルアミノ、N,N-ジペンチルアミノ、N-ブチル-N-ヘキシルアミノ、N-ブチル-N-ヘキシルアミノ又はN,N-ジヘキシルアミノ；

- C₃-C₆-シクロアルキル、及びまたC₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキルのシクロアルキル部分: 3~6個の環員を有する单環式飽和炭化水素、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシル；

- C₃-C₆-ヘテロシクリル、及びまたC₃-C₆-ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキルのヘテロシクリル部分: 3~6個の環員を有する脂肪族複素環であって、炭素原子に加えて、1~4個の窒素原子、又は1~3個の窒素原子と酸素原子若しくは硫黄原子、又は酸素原子若しくは硫黄原子を含有する、脂肪族複素環、例えば、

3又は4員の複素環(2-オキセタニル、3-オキセタニル、2-チエタニル、3-チエタニル、1-アゼチジニル、2-アゼチジニル、1-アゼチニル、2-アゼチニルのような); 5員の飽和複素

10

20

30

40

50

環(2-テトラヒドロフラニル、3-テトラヒドロフラニル、2-テトラヒドロチエニル、3-テトラヒドロチエニル、1-ピロリジニル、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル、3-イソオキサゾリジニル、4-イソオキサゾリジニル、5-イソオキサゾリジニル、2-イソチアゾリジニル、3-イソチアゾリジニル、4-イソチアゾリジニル、5-イソチアゾリジニル、1-ピラゾリジニル、3-ピラゾリジニル、4-ピラゾリジニル、5-ピラゾリジニル、2-オキサゾリジニル、4-オキサゾリジニル、5-オキサゾリジニル、2-チアゾリジニル、4-チアゾリジニル、5-チアゾリジニル、1-イミダゾリジニル、2-イミダゾリジニル、4-イミダゾリジニル、3-オキサゾリジニル、1,2,4-オキサジアゾリジン-3-イル、1,2,4-オキサジアゾリジン-5-イル、3-チアゾリジニル、1,2,4-チアジアゾリジン-3-イル、1,2,4-チアジアゾリジン-5-イル、1,2,4-トリアゾリジン-3-イル、1,2,4-オキサジアゾリジン-2-イル、1,2,4-オキサジアゾリジン-4-イル、1,3,4-オキサジアゾリジン-2-イル、1,2,4-チアジアゾリジン-2-イル、1,2,4-チアジアゾリジン-4-イル、1,3,4-チアジアゾリジン-2-イル、1,2,4-トリアゾリジン-1-イル、1,3,4-トリアゾリジン-2-イルのような);6員の飽和複素環(1-ピペリジニル、2-ピペリジニル、3-ピペリジニル、4-ピペリジニル、1,3-ジオキサン-5-イル、1,4-ジオキサン二環、1,3-ジチアン-5-イル、1,3-ジチアニル、1,3-オキサチアン-5-イル、1,4-オキサチアニル、2-テトラヒドロピラニル、3-テトラヒドロピラニル、4-テトラヒドロピラニル、2-テトラヒドロチオピラニル、3-テトラヒドロチオピラニル、4-テトラヒドロチオピラニル、1-ヘキサヒドロピリダジニル、3-ヘキサヒドロピリダジニル、4-ヘキサヒドロピリダジニル、1-ヘキサヒドロピリミジニル、2-ヘキサヒドロピリミジニル、4-ヘキサヒドロピリミジニル、5-ヘキサヒドロピリミジニル、1-ピペラジニル、2-ピペラジニル、1,3,5-ヘキサヒドロトリアジン-1-イル、1,3,5-ヘキサヒドロトリアジン-2-イル、1,2,4-ヘキサヒドロトリアジン-1-イル、1,2,4-ヘキサヒドロトリアジン-3-イル、テトラヒドロ-1,3-オキサジン-1-イル、テトラヒドロ-1,3-オキサジン-2-イル、テトラヒドロ-1,3-オキサジン-6-イル、1-モルホリニル、2-モルホリニル、3-モルホリニルのような);

- 5又は6員のヘテロアリール:5又は6個の環員を有する芳香族ヘテロアリールであって、炭素原子に加えて、1~4個の窒素原子、又は1~3個の窒素原子と酸素原子若しくは硫黄原子、又は酸素原子若しくは硫黄原子を含有する、芳香族ヘテロアリール、例えば5員の芳香族環(フリル(例えば2-フリル、3-フリル)、チエニル(例えば2-チエニル、3-チエニル)、ピロリル(例えばピロール-2-イル、ピロール-3-イル)、ピラゾリル(例えばピラゾール-3-イル、ピラゾール-4-イル)、イソオキサゾリル(例えばイソオキサゾール-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、イソオキサゾール-5-イル)、イソチアゾリル(例えばイソチアゾール-3-イル、イソチアゾール-4-イル、イソチアゾール-5-イル)、イミダゾリル(例えばイミダゾール-2-イル、イミダゾール-4-イル)、オキサゾリル(例えばオキサゾール-2-イル、オキサゾール-4-イル、オキサゾール-5-イル)、チアゾリル(例えばチアゾール-2-イル、チアゾール-4-イル、チアゾール-5-イル)、オキサジアゾリル(例えば1,2,3-オキサジアゾール-4-イル、1,2,3-オキサジアゾール-5-イル、1,2,4-オキサジアゾール-3-イル、1,2,4-オキサジアゾール-5-イル、1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)、チアジアゾリル(例えば1,2,3-チアジアゾール-4-イル、1,2,3-チアジアゾール-5-イル、1,2,4-チアジアゾール-3-イル)、トリアゾリル(例えば1,2,3-トリアゾール-4-イル、1,2,4-トリアゾール-3-イル)、1-テトラゾリルのような);6員の芳香族環(ピリジル(例えばピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル)、ピラジニル(例えばピリダジン-3-イル、ピリダジン-4-イル)、ピリミジニル(例えばピリミジン-2-イル、ピリミジン-4-イル、ピリミジン-5-イル)、ピラジン-2-イル、トリアジニル(例えば1,3,5-トリアジン-2-イル、1,2,4-トリアジン-3-イル、1,2,4-トリアジン-5-イル、1,2,4-トリアジン-6-イル)のような);

- 3~7員の炭素環:3~7個の環員を有する、3~7員の飽和、部分不飽和又は芳香族单環式芳香族環であって、炭素原子の他に、場合により-N(R¹²)-、-N=N-、-C(=O)-、-O-及び-S-からなる群から選択される1又は2個の環員を含む、单環式芳香族環。

【0030】

本明細書中以下に言及される本発明の好ましい実施形態は、互いに独立して、又は互い

10

20

30

40

50

に組み合わせて好ましいと理解されなければならない。

【0031】

本発明の好ましい実施形態によれば、好ましいのは、可変要素が、互いに独立して、又は互いに組み合わせて以下の意味を有する、式(I)のウラシルピリジンである。

【0032】

好ましいのは、

R^1 が、水素、 NH_2 又は C_1-C_6 -アルキルであり；
好ましくは、 NH_2 又は C_1-C_4 -アルキルであり；
特に好ましくは、 NH_2 又は CH_3 であり；
同様に好ましくは、 C_1-C_6 -アルキルであり；
特に好ましくは、 C_1-C_4 -アルキルであり；
とりわけ好ましくは、 CH_3 である、
式(I)のウラシルピリジンである。

10

【0033】

同様に好ましいのは、

R^2 が、 C_1-C_6 -アルキル又は C_1-C_6 -ハロアルキルであり；
好ましくは、 C_1-C_4 -アルキル又は C_1-C_4 -ハロアルキルであり；
より好ましくは、 C_1-C_4 -ハロアルキルであり；
特に好ましくは、 C_1-C_2 -ハロアルキルであり；
とりわけ好ましくは、 CF_3 である、
式(I)のウラシルピリジンである。

20

【0034】

同様に好ましいのは、

R^3 が、Hであり；
同様に好ましくは、 C_1-C_6 -アルキルであり；
特に好ましくは、 C_1-C_4 -アルキルであり；
とりわけ好ましくは、 CH_3 である、
式(I)のウラシルピリジンである。

【0035】

同様に好ましいのは、

R^4 が、H、F又はClであり；
特に好ましくは、H又はFであり；
とりわけ好ましくは、Hであり；
同様に特に好ましくは、H又はClであり；
とりわけ好ましくは、Clであり；
同様に特に好ましくは、F又はClであり；
とりわけ好ましくは、Fである、
式(I)のウラシルピリジンである。

30

【0036】

同様に好ましいのは、

R^5 が、ハロゲン又はCNであり；
好ましくは、F、Cl、Br又はCNであり；
特に好ましくは、F、Cl又はCNであり；
とりわけ好ましくは、Cl又はCNであり；
より好ましくは、Clであり；
同様により好ましくは、CNであり；
同様にとりわけ好ましくは、F又はClであり；
より好ましくは、Fである、
式(I)のウラシルピリジンである。

40

【0037】

50

同様に好ましいのは、

R^6 が、H、C₁-C₃-アルキル、C₁-C₃-ハロアルキル、C₁-C₃-アルコキシ、C₁-C₃-ハロアルコキシ又はC₁-C₃-アルキルチオであり；

特に好ましくは、H、C₁-C₃-アルキル、C₁-C₃-ハロアルキル又はC₁-C₃-アルコキシであり；

とりわけ好ましくは、H、C₁-C₃-アルキル又はC₁-C₃-アルコキシであり；

より好ましくは、H、CH₃又はOCH₃である、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0038】

同様に好ましいのは、

R^7 が、H、ハロゲン又はC₁-C₃-アルキルであり；

特に好ましくは、H、F又はCH₃であり；

とりわけ好ましくは、Hである、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0039】

同様に好ましいのは、

R^8 が、OR⁹、SR⁹、NR¹⁰R¹¹、NR⁹S(O)₂R¹⁰又はNR⁹S(O)₂NR¹⁰R¹¹であり；

特に好ましくは、OR⁹、NR¹⁰R¹¹、NR⁹S(O)₂R¹⁰又はNR⁹S(O)₂NR¹⁰R¹¹であり；

とりわけ好ましくは、OR⁹、NR⁹S(O)₂R¹⁰又はNR⁹S(O)₂NR¹⁰R¹¹であり；

とりわけ好ましくは、OR⁹又はNR⁹S(O)₂R¹⁰である、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0040】

同様に好ましいのは、

R^9 が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₆-ハロアルケニル、C₃-C₆-ハロアルキニル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルコキシ)C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ハロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルホニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルキニルオキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、アミノ、(C₁-C₆-アルキル)アミノ、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ、(C₁-C₆-アルキルカルボニル)アミノ、アミノ-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、

-N=CR¹²R¹³

(R¹²及びR¹³は、互いに独立して、H、C₁-C₄-アルキル又はフェニルである)、

C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ヘテロシクリル、フェニル、フェニル-C₁-C₄-アルキル又は5若しくは6員のヘテロアリールであり、

シクロアルキル環、ヘテロシクリル環、フェニル環又はヘテロアリール環はそれぞれ、R¹⁴から選択される1~4個の置換基又は3~7員の炭素環により置換されていてもよく、

この炭素環は、炭素原子に加えて、-N(R¹²)-、-N=N-、-C(=O)-、-O-及び-S-からなる群から選択される1又は2個の環員を場合により有しており、

この炭素環は、R¹⁴から選択される1~4個の置換基により場合により置換されており；

R¹⁴が、ハロゲン、NO₂、CN、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ又はC₁-C₄-アルコキシカルボニルであり；

10

20

30

40

50

好ましくは、水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルコキシ)C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキルであり；

特に好ましくは、水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル又はC₁-C₆-ハロアルキルであり；

同様に特に好ましくは、水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル又はC₃-C₆-アルキニルであり；

とりわけ好ましくは、水素、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-アルキニルであり；

より好ましくは、水素、CH₃、C₂H₅、CH₂CH=CH₂又はCH₂C=CHであり；

最も好ましくは、水素、CH₃、C₂H₅又はCH₂C=CHである、
式(I)のウラシルピリジンである。

【0041】

同様に好ましいのは、

R¹⁰が、H、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-シクロアルキルであり；

特に好ましくは、H又はC₁-C₆-アルキルであり；

より好ましくは、Hであり；

同様により好ましくは、C₁-C₆-アルキルである、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0042】

同様に好ましいのは、

R¹¹が、H、C₁-C₆-アルキル又はC₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキルであり；

特に好ましくは、H又はC₁-C₆-アルキルであり；

より好ましくは、Hであり；

同様により好ましくは、C₁-C₆-アルキルである、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0043】

同様に好ましいのは、

R¹²が、フェニル又はC₁-C₄-アルキルであり；

特に好ましくは、フェニル又はCH₃であり；

同様に特に好ましくは、フェニルであり；

同様に特に好ましくは、C₁-C₄-アルキルである、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0044】

同様に好ましいのは、

R¹³が、フェニル又はC₁-C₄-アルキルであり；

特に好ましくは、フェニル又はCH₃であり；

同様に特に好ましくは、フェニルであり；

同様に特に好ましくは、C₁-C₄-アルキルである、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0045】

同様に好ましいのは、

R¹⁴が、ハロゲン又はC₁-C₆-アルキルであり；

特に好ましくは、F、Cl又はCH₃であり；

同様に特に好ましくは、ハロゲンであり；

とりわけ好ましくは、F又はClであり；

同様に特に好ましくは、C₁-C₆-アルキルであり；

とりわけ好ましくは、CH₃である、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0046】

10

20

30

40

50

同様に好ましいのは、
nが、1又は2であり；
特に好ましくは、2であり；
同様に特に好ましくは、1である、
式(I)のウラシルピリジンである。

【0047】

同様に好ましいのは、
Qが、O、S、SO、SO₂、NH又は(C₁-C₃-アルキル)Nであり；
好ましくは、O又はSであり；
特に好ましくは、Oである、
式(I)のウラシルピリジンである。

【0048】

同様に好ましいのは、
Wが、Oであり、
同様に好ましくは、Sである、
式(I)のウラシルピリジンである。

【0049】

同様に好ましいのは、
Xが、Oであり、
同様に好ましくは、Sである、
式(I)のウラシルピリジンである。

【0050】

同様に好ましいのは、
Yが、Oであり、
同様に好ましくは、Sである、
式(I)のウラシルピリジンである。

【0051】

同様に好ましいのは、
Zが、それぞれ、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ及びC₁-C₆-ハロアルコキシからなる群から選択される、1～4個の置換基により場合により置換されている、フェニル又はピリジルであり；

好ましくは、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ及びC₁-C₆-ハロアルコキシからなる群から選択される、1～4個の置換基により場合により置換されているフェニルであり；

さらに好ましくは、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ及びC₁-C₆-ハロアルコキシからなる群から選択される、1～4個の置換基により場合により置換されているピリジルである、
式(I)のウラシルピリジンである。

【0052】

同様に好ましいのは、
Zが、それぞれ、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ及びC₁-C₆-ハロアルコキシからなる群から選択される、1～4個の置換基により場合により置換されている、フェニル又はピリジルであり；

好ましくは、それぞれ、ハロゲン、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ又はC₁-C₆-ハロアルコキシからなる群から選択される、1～4個の置換基により場合により置換されている、フェニル又はピリジルであり；

特に好ましくは、それぞれ、ハロゲン又はC₁-C₆-アルキルからなる群から選択される、1～4個の置換基により場合により置換されている、フェニル又はピリジルであり；

とりわけ好ましくは、それぞれ、F、Cl又はCH₃からなる群から選択される、1～4個の置換基により場合により置換されている、フェニル又はピリジルであり；

10

20

30

40

50

より好ましくは、それぞれ、非置換である、フェニル又はピリジルである、式(I)のウラシルピリジンである。

【0053】

同様に好ましいのは、

Zが、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ及びC₁-C₆-ハロアルコキシからなる群から選択される、1~4個の置換基により場合により置換されているフェニルであり；

好ましくは、ハロゲン、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ又はC₁-C₆-ハロアルコキシからなる群から選択される、1~4個の置換基により場合により置換されているフェニルであり；

特に好ましくは、ハロゲン又はC₁-C₆-アルキルからなる群から選択される、1~4個の置換基により場合により置換されているフェニルであり；

とりわけ好ましくは、F、Cl又はCH₃からなる群から選択される、1~4個の置換基により場合により置換されているフェニルであり；

より好ましくは、非置換フェニルである、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0054】

同様に好ましいのは、

Zが、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ及びC₁-C₆-ハロアルコキシからなる群から選択される、1~3個の置換基により場合により置換されているピリジルであり；

好ましくは、ハロゲン、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ又はC₁-C₆-ハロアルコキシからなる群から選択される、1~3個の置換基により場合により置換されているピリジルであり；

特に好ましくは、ハロゲン又はC₁-C₆-アルキルからなる群から選択される、1~3個の置換基により場合により置換されているピリジルであり；

とりわけ好ましくは、F、Cl又はCH₃からなる群から選択される、1~3個の置換基により場合により置換されているピリジルであり；

より好ましくは、非置換ピリジルである、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0055】

同様に好ましいのは、

Zが、Z¹~Z²⁹

【0056】

10

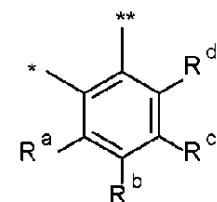
20

30

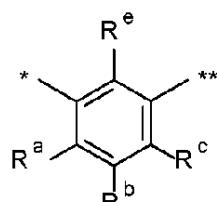
40

50

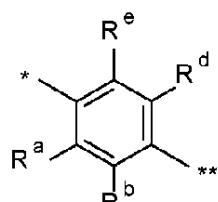
【化 3】



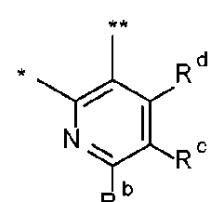
Z-1



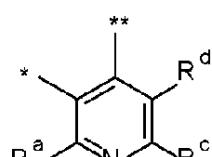
Z-2



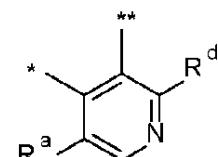
Z-3



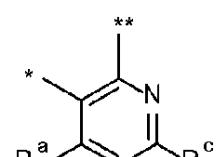
Z-4



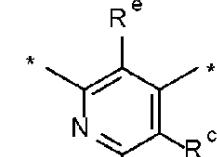
Z-5



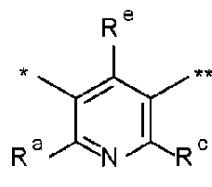
Z-6



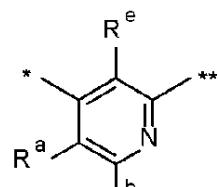
Z-7



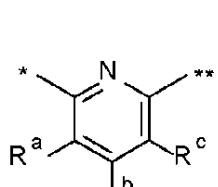
Z-8



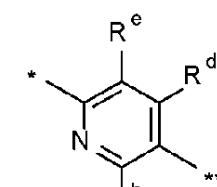
Z-9



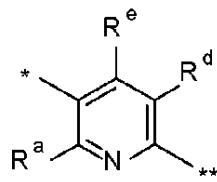
Z-10



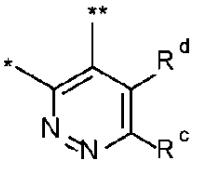
Z-11



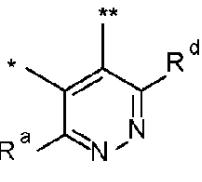
Z-12



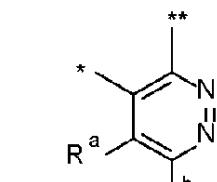
Z-13



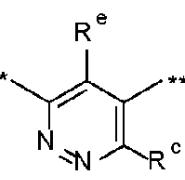
Z-14



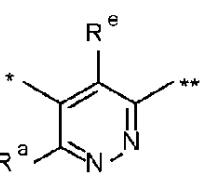
Z-15



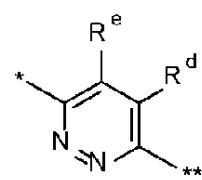
Z-16



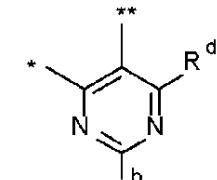
Z-17



Z-18



Z-19



Z-20

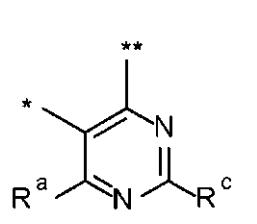
10

20

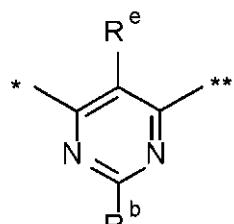
30

40

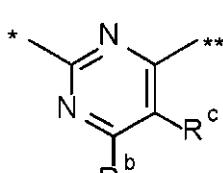
50



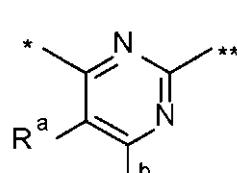
Z-21



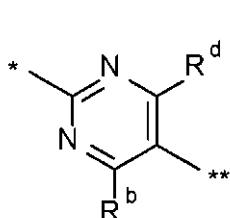
Z-22



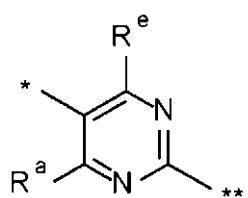
Z-23



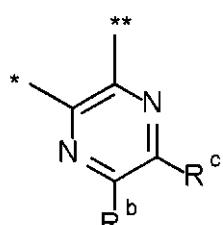
Z-24



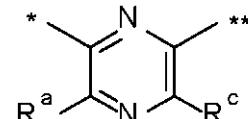
Z-25



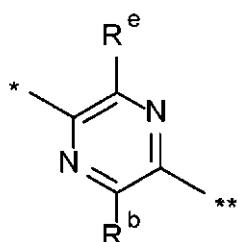
Z-26



Z-27



Z-28



Z-29

20

30

(式中、

*は、ZのXへの結合点を表し、

**は、ZのQへの結合点を表し、

Ra、Rb、Rc、Rd及びReは、互いに独立して、

H、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシであり；好ましくは、H、ハロゲン、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ又はC₁-C₆-ハロアルコキシであり；特に好ましくは、H、ハロゲン又はC₁-C₆-アルキルであり；とりわけ好ましくは、H、F、Cl又はCH₃であり；

より好ましくは、Hである)

からなる群から選択される、式(I)のウラシルピリジンである。

【0057】

同様に好ましいのは、

Zが、上記に定義される、Z¹、Z²、Z³、Z⁴、Z⁵、Z⁶、Z⁷、Z⁸、Z⁹、Z¹⁰、Z¹¹、Z¹²、Z¹³及びZ²¹からなる群から選択され；特に好ましくは、上記に定義される、Z¹、Z²、Z⁴、Z⁵、Z⁶、Z⁷、Z⁸、Z⁹、Z¹⁰、Z¹¹及びZ²¹からなる群から選択され；より特に好ましくは、上記に定義される、Z¹、Z⁴、Z⁵、Z⁶、Z⁷及びZ²¹からなる群から選択され；

40

50

とりわけ好ましくは、上記に定義される、 Z^1 、 Z^4 、 Z^5 、 Z^6 及び Z^7 からなる群から選択され；

より好ましくは、上記に定義される、 Z^1 及び Z^7 からなる群から選択される、式(I)のウラシルピリジンである。

【 0 0 5 8 】

同様に好ましいのは、

Z が、上記に定義される、 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 Z^4 、 Z^5 、 Z^6 、 Z^7 、 Z^8 、 Z^9 、 Z^{10} 、 Z^{11} 、 Z^{12} 、 Z^{13} 及び Z^{21} からなる群から選択され、

R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 及び R^e が、互いに独立して、

H、ハロゲン、CN、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -ハロアルコキシ 10 であり；

好ましくは、H、ハロゲン、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ又は C_1 - C_6 -ハロアルコキシであり；

特に好ましくは、H、ハロゲン又は C_1 - C_6 -アルキルであり；

とりわけ好ましくは、H、F、CI又は CH_3 であり；

より好ましくは、Hであり；

特に好ましくは、上記に定義される、 Z^1 、 Z^2 、 Z^4 、 Z^5 、 Z^6 、 Z^7 、 Z^8 、 Z^9 、 Z^{10} 、 Z^{11} 及び Z^{21} からなる群から選択され、

R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 及び R^e が、互いに独立して、

H、ハロゲン、CN、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -ハロアルコキシ 20 であり；

好ましくは、H、ハロゲン、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ又は C_1 - C_6 -ハロアルコキシであり；

特に好ましくは、H、ハロゲン又は C_1 - C_6 -アルキルであり；

とりわけ好ましくは、H、F、CI又は CH_3 であり；

より好ましくは、Hであり；

より特に好ましくは、上記に定義される、 Z^1 、 Z^4 、 Z^5 、 Z^6 、 Z^7 及び Z^{21} からなる群から選択され、

R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 及び R^e が、互いに独立して、

H、ハロゲン、CN、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -ハロアルコキシ 30 であり；

好ましくは、H、ハロゲン、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ又は C_1 - C_6 -ハロアルコキシであり；

特に好ましくは、H、ハロゲン又は C_1 - C_6 -アルキルであり；

とりわけ好ましくは、H、F、CI又は CH_3 であり；

より好ましくは、Hであり；

とりわけ好ましくは、上記に定義される、 Z^1 、 Z^4 、 Z^5 、 Z^6 及び Z^7 からなる群から選択され、

R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 及び R^e が、互いに独立して、

H、ハロゲン、CN、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -ハロアルコキシ 40 であり；

好ましくは、H、ハロゲン、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ又は C_1 - C_6 -ハロアルコキシであり；

特に好ましくは、H、ハロゲン又は C_1 - C_6 -アルキルであり；

とりわけ好ましくは、H、F、CI又は CH_3 であり；

より好ましくは、Hであり；

より好ましくは、上記に定義される、 Z^1 及び Z^7 からなる群から選択され、

R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 及び R^e が、互いに独立して、

H、ハロゲン、CN、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -ハロアルコキシ 50 であり；

好ましくは、H、ハロゲン、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ又はC₁-C₆-ハロアルコキシであり；

特に好ましくは、H、ハロゲン又はC₁-C₆-アルキルであり；

とりわけ好ましくは、H、F、Cl又はCH₃であり；

より好ましくは、Hである、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0059】

同様に好ましいのは、

R¹が、C₁-C₆-アルキルであり、

R²が、C₁-C₄-ハロアルキルであり、

R³が、Hであり、

Yが、Oである、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0060】

同様に好ましいのは、

R⁴が、H又はFであり、

R⁵が、F、Cl、Br又はCNである、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0061】

同様に好ましいのは、

R⁴が、H又はFであり、

R⁵が、F、Cl又はCNである、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0062】

同様に好ましいのは、

R⁶が、H、C₁-C₃-アルキル又はC₁-C₃-アルコキシであり、

R⁷が、Hである、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0063】

同様に好ましいのは、

R⁸が、OR⁹、NR⁹S(O)₂R¹⁰又はNR⁹S(O)₂NR¹⁰R¹¹であり、

R⁹が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルコキシ)C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキルであり；

R¹⁰、R¹¹が、C₁-C₆-アルキルである、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0064】

同様に好ましいのは、

nが、1である、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0065】

同様に好ましいのは、

Q、W及びXが、Oである、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0066】

同様に好ましいのは、

R¹が、水素、NH₂又はC₁-C₆-アルキルであり；

R²が、C₁-C₆-アルキル又はC₁-C₆-ハロアルキルであり；

R³が、Hであり；

10

20

30

40

50

R^4 が、H又はハロゲンであり；

R^5 が、ハロゲン又はCNであり；

R^6 が、H、 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 -ハロアルコキシ又は C_1 - C_3 -アルキルチオであり；

R^7 が、Hであり；

R^8 が、 OR^9 、 SR^9 、 $NR^{10}R^{11}$ 、 $NR^9S(O)_2R^{10}$ 又は $NR^9S(O)_2NR^{10}R^{11}$ であり、

R^9 が、水素、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -アルケニル、 C_3 - C_6 -アルキニル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -ハロアルケニル、 C_3 - C_6 -ハロアルキニル、 C_1 - C_6 -シアノアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 $-(C_1$ - C_6 -アルコキシ) C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルコキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -アルケニルオキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -ハロアルケニルオキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -アルケニルオキシ- C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキルチオ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキルスルフィニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキルスルホニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキルカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルコキシカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -アルケニルオキシカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、アミノ、 $(C_1$ - C_6 -アルキル)アミノ、 $-(C_1$ - C_6 -アルキル)アミノ、 $-(C_1$ - C_6 -アルキル)アミノ、 $(C_1$ - C_6 -アルキル)アミノ、 $(C_1$ - C_6 -アルキルカルボニル)アミノ、アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、 $(C_1$ - C_6 -アルキル)アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、 $-(C_1$ - C_6 -アルキル)アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、アミノカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 $(C_1$ - C_6 -アルキル)アミノカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 $-(C_1$ - C_6 -アルキル)アミノカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、

$-N=CR^{12}R^{13}$ (R^{12} 及び R^{13} は、互いに独立して、H、 C_1 - C_4 -アルキル又はフェニルである)、

C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -ヘテロシクリル、フェニル、フェニル- C_1 - C_4 -アルキル又は5若しくは6員のヘテロアリールであり、

シクロアルキル環、ヘテロシクリル環、フェニル環又はヘテロアリール環はそれぞれ、 R^{14} から選択される1~4個の置換基又は3~7員の炭素環により置換されていてもよく、

この炭素環は、炭素原子に加えて、 $-N(R^{12})-$ 、 $-N=N-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-O-$ 及び $-S-$ からなる群から選択される1又は2個の環員を場合により有しております、

この炭素環は、 R^{14} から選択される1~4個の置換基により場合により置換されており；

R^{10} が、 C_1 - C_6 -アルキルであり；

R^{11} が、H又は C_1 - C_6 -アルキルであり；

R^{12} が、フェニル又は CH_3 であり；

R^{13} が、フェニル又は CH_3 であり；

R^{14} が、ハロゲン又は C_1 - C_6 -アルキルであり；

n が、1又は2であり；

Q が、O、S、 SO 、 SO_2 、NH又は $(C_1$ - C_3 -アルキル)Nであり；

W が、Oであり；

X が、Oであり；

Y が、Oであり；

Z が、上記に定義される、 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 Z^4 、 Z^5 、 Z^6 、 Z^7 、 Z^8 、 Z^9 、 Z^{10} 、 Z^{11} 、 Z^{12} 、 Z^{13} 及び Z^{21} であり、 R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 及び R^e が、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -ハロアルコキシである、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0067】

特に好ましいのは、

R^1 が、 NH_2 又は C_1 - C_4 -アルキルであり；

10

20

30

40

50

R^2 が、C₁-C₄-アルキル又はC₁-C₄-ハロアルキルであり；
 R^3 が、Hであり；
 R^4 が、H又はハロゲンであり；
 R^5 が、ハロゲン又はCNであり；
 R^6 が、H、C₁-C₃-アルキル、C₁-C₃-ハロアルキル又はC₁-C₃-アルコキシであり；
 R^7 が、Hであり；
 R^8 が、OR⁹、NR¹⁰R¹¹、NR⁹S(O)₂R¹⁰又はNR⁹S(O)₂NR¹⁰R¹¹であり；

R^9 が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルコキシ)C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキルであり；

R^{10} が、C₁-C₆-アルキルであり；
 R^{11} が、H又はC₁-C₆-アルキルであり；
 n が、1であり；
 Q が、O、S、SO、SO₂、NH又は(C₁-C₃-アルキル)Nであり；
 W が、Oであり；
 X が、Oであり；
 Y が、Oであり；

Z が、上記に定義される、Z¹、Z²、Z⁴、Z⁵、Z⁶、Z⁷、Z⁸、Z⁹、Z¹⁰、Z¹¹及びZ²¹からなる群から選択され、R^a、R^b、R^c、R^d及びR^eが、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシである。

式(I)のウラシルピリジンである。

【0068】

とりわけ好ましいのは、
 R^1 が、NH₂又はCH₃であり；
 R^2 が、C₁-C₄-ハロアルキルであり；
 R^3 が、Hであり；
 R^4 が、H、F又はClであり；
 R^5 が、F、Cl、Br又はCNであり；
 R^6 が、H、C₁-C₃-アルキル又はC₁-C₃-アルコキシであり；
 R^7 が、Hであり；
 R^8 が、OR⁹又はNR⁹S(O)₂R¹⁰であり、

R^9 が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル又はC₁-C₆-ハロアルキルであり、

R^{10} が、C₁-C₆-アルキルであり；

n が、1であり；

Q が、O又はSであり；

W が、Oであり；

X が、Oであり；

Y が、Oであり；

Z が、上記に定義される、Z¹、Z⁴、Z⁵、Z⁶、Z⁷及びZ²¹からなる群から選択され、R^a、R^b、R^c、R^d及びR^eが、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシである、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0069】

同様にとりわけ好ましいのは、

R^1 が、NH₂又はCH₃であり；

R^2 が、C₁-C₄-ハロアルキルであり；

R^3 が、Hであり；

10

20

30

40

50

R^4 が、H、F又はClであり；
 R^5 が、F、Cl又はCNであり；
 R^6 が、H、C₁-C₃-アルキル又はC₁-C₃-アルコキシであり；
 R^7 が、Hであり；
 R^8 が、OR⁹又はNR⁹S(O)₂R¹⁰であり、
 R^9 が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル又はC₁-C₆-ハロアルキルであり、
 R^{10} が、C₁-C₆-アルキルであり；
 n が、1であり；
 Q が、O又はSであり；
 W が、Oであり；
 X が、Oであり；
 Y が、Oであり；
 Z が、上記に定義される、Z¹、Z⁴、Z⁵、Z⁶及びZ⁷からなる群から選択され、R^a、R^b、R^c、R^d及びR^eが、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシである、
式(I)のウラシルピリジンである。

【0070】

より好ましいのは、

R^1 が、CH₃であり；
 R^2 が、CF₃であり；
 R^3 が、Hであり；
 R^4 が、H、F又はClであり；
 R^5 が、F、Cl、Br又はCNであり；
 R^6 が、H、CH₃又はOCH₃であり；
 R^7 が、Hであり；
 R^8 が、OR⁹又はNR⁹S(O)₂R¹⁰であり；
 R^9 が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル又はC₃-C₆-アルキニルであり、
 R^{10} が、C₁-C₆-アルキルであり；
 n が、1であり；
 Q が、Oであり；
 W が、Oであり；
 X が、Oであり；
 Y が、Oであり；
 Z が、上記に定義される、Z¹及びZ⁷からなる群から選択され、R^a、R^b、R^c、R^d及びR^eは、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシである、
式(I)のウラシルピリジンである。

【0071】

同様により好ましいのは、

R^1 が、CH₃であり；
 R^2 が、CF₃であり；
 R^3 が、Hであり；
 R^4 が、H、F又はClであり；
 R^5 が、F、Cl又はCNであり；
 R^6 が、H、CH₃又はOCH₃であり；
 R^7 が、Hであり；
 R^8 が、OR⁹又はNR⁹S(O)₂R¹⁰であり；
 R^9 が、水素、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-アルキニルであり、
 R^{10} が、C₁-C₆-アルキルであり；
 n が、1であり；
 Q が、Oであり；
 W が、Oであり；
 X が、Oであり；
 Y が、Oであり；
 Z が、上記に定義される、Z¹及びZ⁷からなる群から選択され、R^a、R^b、R^c、R^d及びR^eは、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシである、
式(I)のウラシルピリジンである。

10

20

30

40

50

nが、1であり；

Qが、Oであり；

Wが、Oであり；

Xが、Oであり；

Yが、Oであり；

Zが、上記に定義される、Z¹及びZ⁷からなる群から選択され、R^a、R^b、R^c、R^d及びR^eは、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシである、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0072】

10

同様に好ましいのは、

R¹が、CH₃であり；

R²が、CF₃であり；

R³が、Hであり；

R⁴が、H、F又はClであり；

R⁵が、F、Cl、Br又はCNであり；

R⁶が、H、CH₃又はOCH₃であり；

R⁷が、Hであり；

R⁸が、OR⁹、SR⁹、NR¹⁰R¹¹、NR⁹OR⁹、NR⁹S(O)₂R¹⁰又はNR⁹S(O)₂NR¹⁰R¹¹であり

、

R⁹が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₆-ハロアルケニル、C₃-C₆-ハロアルキニル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルコキシ)C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ハロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルホニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルキニルオキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、アミノ、(C₁-C₆-アルキル)アミノ、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ、(C₁-C₆-アルキルカルボニル)アミノ、アミノ-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、

-N=CR¹²R¹³(R¹²及びR¹³は、互いに独立して、H、C₁-C₄-アルキル又はフェニルである)、

C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ヘテロシクリル、C₃-C₆-ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル、フェニル、フェニル-C₁-C₄-アルキル又は5若しくは6員のヘテロアリールであり、

シクロアルキル環、ヘテロシクリル環、フェニル環又はヘテロアリール環はそれぞれ、R¹⁴から選択される1～4個の置換基又は3～7員の炭素環により置換されていてもよく、

この炭素環は、炭素原子に加えて、-N(R¹²)-、-N=N-、-C(=O)-、-O-及び-S-からなる群から選択される1又は2個の環員を場合により有しており、

この炭素環は、R¹⁴から選択される1～4個の置換基により場合により置換されており；

R¹⁴が、ハロゲン、NO₂、CN、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ又はC₁-C₄-アルコキシカルボニルであり；

R¹⁰、R¹¹が、互いに独立して、R⁹であるか、又は一緒になって3～7員の炭素環を形成

20

30

40

50

し、

この炭素環は、炭素原子に加えて、-N(R¹²)-、-N=N-、-C(=O)-、-O-及び-S-からなる群から選択される1又は2個の環員を場合により有しており、

この炭素環は、R¹⁴から選択される1~4個の置換基により場合により置換されており；nが、1であり；

Qが、Oであり；

Wが、Oであり；

Xが、Oであり；

Yが、Oであり；

Zが、上記に定義される、Z¹及びZ⁷からなる群から選択され、R^a、R^b、R^c、R^d及びR^eは、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシである、

式(I)のウラシルピリジンである。

【0073】

同様に好ましいのは、

R¹が、CH₃であり；

R²が、CF₃であり；

R³が、Hであり；

R⁴が、H、F又はClであり；

R⁵が、F、Cl又はCNであり；

R⁶が、H、CH₃又はOCH₃であり；

R⁷が、Hであり；

R⁸が、OR⁹、SR⁹、NR¹⁰R¹¹、NR⁹OR⁹、NR⁹S(O)₂R¹⁰又はNR⁹S(O)₂NR¹⁰R¹¹であり、

R⁹が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₆-ハロアルケニル、C₃-C₆-ハロアルキニル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルコキシ)C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ハロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルホニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルキニルオキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、アミノ、(C₁-C₆-アルキル)アミノ、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ、(C₁-C₆-アルキルカルボニル)アミノ、アミノ-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、

-N=CR¹²R¹³(R¹²及びR¹³は、互いに独立して、H、C₁-C₄-アルキル又はフェニルである)、

C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ヘテロシクリル、C₃-C₆-ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル、フェニル、フェニル-C₁-C₄-アルキル又は5員若しくは6員のヘテロアリールであり、

シクロアルキル環、ヘテロシクリル環、フェニル環又はヘテロアリール環はそれ、R¹⁴から選択される1~4個の置換基又は3~7員の炭素環により置換されていてもよく、

この炭素環は、炭素原子に加えて、-N(R¹²)-、-N=N-、-C(=O)-、-O-及び-S-からなる群から選択される1又は2個の環員を場合により有しており、

この炭素環は、R¹⁴から選択される1~4個の置換基により場合により置換されて

10

20

30

40

50

おり、

R^{14} が、ハロゲン、 NO_2 、 CN 、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ又は C_1-C_4 -アルコキシカルボニルであり；

R^{10} 、 R^{11} が、互いに独立して、 R^9 であるか、又は一緒になって3～7員の炭素環を形成し、

この炭素環は、炭素原子に加えて、 $-N(R^{12})-$ 、 $-N=N-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-O-$ 及び $-S-$ からなる群から選択される1又は2個の環員を場合により有しており、

この炭素環は、 R^{14} から選択される1～4個の置換基により場合により置換されており；
 n が、1であり；

Q が、Oであり；

W が、Oであり；

X が、Oであり；

Y が、Oであり；

Z が、上記に定義される、 Z^1 及び Z^7 からなる群から選択され、 R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 及び R^e は、互いに独立して、H、ハロゲン、 CN 、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシである、

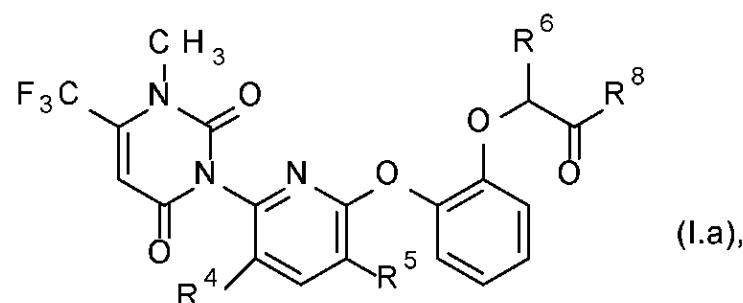
式(I)のウラシルピリジンである。

【0074】

特に好ましいのは、式(I.a) (R^1 が CH_3 であり、 R^2 が CF_3 であり、 R^3 がHであり、 R^7 がHであり、 n が1であり、 Q 、 W 、 X 及び Y が、Oであり、 Z が、定義される $Z-1$ であり、 R^a 、 R^b 、 R^c 及び R^d が、Hである、式(I)に対応する)：

【0075】

【化4】



のウラシルピリミジンであり、可変要素 R^4 、 R^5 、 R^6 及び R^8 は、上記に定義される意味、特に好ましい意味を有する。

【0076】

特に好ましいのは、表Aの式(I.a.1)～(I.a.672)、好ましくは(I.a.1)～(I.a.504)の化合物であり、可変要素 R^4 、 R^5 、 R^6 及び R^8 の定義は、互いに組み合わせてだけではなく、各場合においてそれ自体も、本発明による化合物にとって特に重要である。

【0077】

10

20

30

40

50

【表 1】

表 A

番号	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁸
I.a.1.	H	F	H	OH
I.a.2.	H	F	H	OCH ₃
I.a.3.	H	F	H	OC ₂ H ₅
I.a.4.	H	F	H	OCH(CH ₃) ₂
I.a.5.	H	F	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.6.	H	F	H	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.7.	H	F	H	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.8.	H	F	H	OCH ₂ C≡CH
I.a.9.	H	F	H	OCH ₂ CF ₃
I.a.10.	H	F	H	OCH ₂ CHF ₂
I.a.11.	H	F	H	OC ₆ H ₅
I.a.12.	H	F	H	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.13.	H	F	H	OCH ₂ OCH ₃
I.a.14.	H	F	H	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.15.	H	F	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.16.	H	F	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.17.	H	F	H	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.18.	H	F	H	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.19.	H	F	H	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.20.	H	F	H	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.21.	H	F	H	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.22.	H	F	H	OCH ₂ -シクロブチル
I.a.23.	H	F	H	SCH ₃
I.a.24.	H	F	H	SC ₂ H ₅
I.a.25.	H	F	H	NHSO ₂ CH ₃
I.a.26.	H	F	H	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.27.	H	F	H	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.28.	H	F	H	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.29.	H	F	CH ₃	OH
I.a.30.	H	F	CH ₃	OCH ₃
I.a.31.	H	F	CH ₃	OC ₂ H ₅
I.a.32.	H	F	CH ₃	OCH(CH ₃) ₂
I.a.33.	H	F	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.34.	H	F	CH ₃	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.35.	H	F	CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.36.	H	F	CH ₃	OCH ₂ C≡CH
I.a.37.	H	F	CH ₃	OCH ₂ CF ₃
I.a.38.	H	F	CH ₃	OCH ₂ CHF ₂
I.a.39.	H	F	CH ₃	OC ₆ H ₅

10

20

30

40

I.a.40.	H	F	CH ₃	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.41.	H	F	CH ₃	OCH ₂ OCH ₃
I.a.42.	H	F	CH ₃	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.43.	H	F	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.44.	H	F	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.45.	H	F	CH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.46.	H	F	CH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.47.	H	F	CH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.48.	H	F	CH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.49.	H	F	CH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.50.	H	F	CH ₃	OCH ₂ -シクロブチル
I.a.51.	H	F	CH ₃	SCH ₃
I.a.52.	H	F	CH ₃	SC ₂ H ₅
I.a.53.	H	F	CH ₃	NHSO ₂ CH ₃
I.a.54.	H	F	CH ₃	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.55.	H	F	CH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.56.	H	F	CH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.57.	H	F	OCH ₃	OH
I.a.58.	H	F	OCH ₃	OCH ₃
I.a.59.	H	F	OCH ₃	OC ₂ H ₅
I.a.60.	H	F	OCH ₃	OCH(CH ₃) ₂
I.a.61.	H	F	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.62.	H	F	OCH ₃	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.63.	H	F	OCH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.64.	H	F	OCH ₃	OCH ₂ C≡CH
I.a.65.	H	F	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃
I.a.66.	H	F	OCH ₃	OCH ₂ CHF ₂
I.a.67.	H	F	OCH ₃	OC ₆ H ₅
I.a.68.	H	F	OCH ₃	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.69.	H	F	OCH ₃	OCH ₂ OCH ₃
I.a.70.	H	F	OCH ₃	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.71.	H	F	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.72.	H	F	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.73.	H	F	OCH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.74.	H	F	OCH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.75.	H	F	OCH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.76.	H	F	OCH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.77.	H	F	OCH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.78.	H	F	OCH ₃	OCH ₂ -シクロブチル
I.a.79.	H	F	OCH ₃	SCH ₃
I.a.80.	H	F	OCH ₃	SC ₂ H ₅
I.a.81.	H	F	OCH ₃	NHSO ₂ CH ₃
I.a.82.	H	F	OCH ₃	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂

10

20

30

40

50

I.a.83.	H	F	OCH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.84.	H	F	OCH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.85.	H	Cl	H	OH
I.a.86.	H	Cl	H	OCH ₃
I.a.87.	H	Cl	H	OC ₂ H ₅
I.a.88.	H	Cl	H	OCH(CH ₃) ₂
I.a.89.	H	Cl	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.90.	H	Cl	H	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.91.	H	Cl	H	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.92.	H	Cl	H	OCH ₂ C≡CH
I.a.93.	H	Cl	H	OCH ₂ CF ₃
I.a.94.	H	Cl	H	OCH ₂ CHF ₂
I.a.95.	H	Cl	H	OC ₆ H ₅
I.a.96.	H	Cl	H	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.97.	H	Cl	H	OCH ₂ OCH ₃
I.a.98.	H	Cl	H	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.99.	H	Cl	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.100.	H	Cl	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.101.	H	Cl	H	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.102.	H	Cl	H	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.103.	H	Cl	H	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.104.	H	Cl	H	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.105.	H	Cl	H	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.106.	H	Cl	H	OCH ₂ -シクロブチル
I.a.107.	H	Cl	H	SCH ₃
I.a.108.	H	Cl	H	SC ₂ H ₅
I.a.109.	H	Cl	H	NHSO ₂ CH ₃
I.a.110.	H	Cl	H	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.111.	H	Cl	H	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.112.	H	Cl	H	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.113.	H	Cl	CH ₃	OH
I.a.114.	H	Cl	CH ₃	OCH ₃
I.a.115.	H	Cl	CH ₃	OC ₂ H ₅
I.a.116.	H	Cl	CH ₃	OCH(CH ₃) ₂
I.a.117.	H	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.118.	H	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.119.	H	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.120.	H	Cl	CH ₃	OCH ₂ C≡CH
I.a.121.	H	Cl	CH ₃	OCH ₂ CF ₃
I.a.122.	H	Cl	CH ₃	OCH ₂ CHF ₂
I.a.123.	H	Cl	CH ₃	OC ₆ H ₅
I.a.124.	H	Cl	CH ₃	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.125.	H	Cl	CH ₃	OCH ₂ OCH ₃

10

20

30

40

50

I.a.126.	H	Cl	CH ₃	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.127.	H	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.128.	H	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.129.	H	Cl	CH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.130.	H	Cl	CH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.131.	H	Cl	CH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.132.	H	Cl	CH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.133.	H	Cl	CH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.134.	H	Cl	CH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.135.	H	Cl	CH ₃	SCH ₃
I.a.136.	H	Cl	CH ₃	SC ₂ H ₅
I.a.137.	H	Cl	CH ₃	NHSO ₂ CH ₃
I.a.138.	H	Cl	CH ₃	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.139.	H	Cl	CH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.140.	H	Cl	CH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.141.	H	Cl	OCH ₃	OH
I.a.142.	H	Cl	OCH ₃	OCH ₃
I.a.143.	H	Cl	OCH ₃	OC ₂ H ₅
I.a.144.	H	Cl	OCH ₃	OCH(CH ₃) ₂
I.a.145.	H	Cl	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.146.	H	Cl	OCH ₃	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.147.	H	Cl	OCH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.148.	H	Cl	OCH ₃	OCH ₂ C≡CH
I.a.149.	H	Cl	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃
I.a.150.	H	Cl	OCH ₃	OCH ₂ CHF ₂
I.a.151.	H	Cl	OCH ₃	OC ₆ H ₅
I.a.152.	H	Cl	OCH ₃	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.153.	H	Cl	OCH ₃	OCH ₂ OCH ₃
I.a.154.	H	Cl	OCH ₃	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.155.	H	Cl	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.156.	H	Cl	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.157.	H	Cl	OCH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.158.	H	Cl	OCH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.159.	H	Cl	OCH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.160.	H	Cl	OCH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.161.	H	Cl	OCH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.162.	H	Cl	OCH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.163.	H	Cl	OCH ₃	SCH ₃
I.a.164.	H	Cl	OCH ₃	SC ₂ H ₅
I.a.165.	H	Cl	OCH ₃	NHSO ₂ CH ₃
I.a.166.	H	Cl	OCH ₃	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.167.	H	Cl	OCH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.168.	H	Cl	OCH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]

10

20

30

40

50

I.a.169.	H	CN	H	OH
I.a.170.	H	CN	H	OCH ₃
I.a.171.	H	CN	H	OC ₂ H ₅
I.a.172.	H	CN	H	OCH(CH ₃) ₂
I.a.173.	H	CN	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.174.	H	CN	H	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.175.	H	CN	H	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.176.	H	CN	H	OCH ₂ C≡CH
I.a.177.	H	CN	H	OCH ₂ CF ₃
I.a.178.	H	CN	H	OCH ₂ CHF ₂
I.a.179.	H	CN	H	OC ₆ H ₅
I.a.180.	H	CN	H	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.181.	H	CN	H	OCH ₂ OCH ₃
I.a.182.	H	CN	H	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.183.	H	CN	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.184.	H	CN	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.185.	H	CN	H	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.186.	H	CN	H	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.187.	H	CN	H	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.188.	H	CN	H	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.189.	H	CN	H	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.190.	H	CN	H	OCH ₂ -シクロブチル
I.a.191.	H	CN	H	SCH ₃
I.a.192.	H	CN	H	SC ₂ H ₅
I.a.193.	H	CN	H	NHSO ₂ CH ₃
I.a.194.	H	CN	H	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.195.	H	CN	H	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.196.	H	CN	H	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.197.	H	CN	CH ₃	OH
I.a.198.	H	CN	CH ₃	OCH ₃
I.a.199.	H	CN	CH ₃	OC ₂ H ₅
I.a.200.	H	CN	CH ₃	OCH(CH ₃) ₂
I.a.201.	H	CN	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.202.	H	CN	CH ₃	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.203.	H	CN	CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.204.	H	CN	CH ₃	OCH ₂ C≡CH
I.a.205.	H	CN	CH ₃	OCH ₂ CF ₃
I.a.206.	H	CN	CH ₃	OCH ₂ CHF ₂
I.a.207.	H	CN	CH ₃	OC ₆ H ₅
I.a.208.	H	CN	CH ₃	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.209.	H	CN	CH ₃	OCH ₂ OCH ₃
I.a.210.	H	CN	CH ₃	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.211.	H	CN	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃

10

20

30

40

50

I.a.212.	H	CN	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.213.	H	CN	CH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.214.	H	CN	CH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.215.	H	CN	CH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.216.	H	CN	CH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.217.	H	CN	CH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.218.	H	CN	CH ₃	OCH ₂ -シクロブチル
I.a.219.	H	CN	CH ₃	SCH ₃
I.a.220.	H	CN	CH ₃	SC ₂ H ₅
I.a.221.	H	CN	CH ₃	NHSO ₂ CH ₃
I.a.222.	H	CN	CH ₃	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.223.	H	CN	CH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.224.	H	CN	CH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.225.	H	CN	OCH ₃	OH
I.a.226.	H	CN	OCH ₃	OCH ₃
I.a.227.	H	CN	OCH ₃	OC ₂ H ₅
I.a.228.	H	CN	OCH ₃	OCH(CH ₃) ₂
I.a.229.	H	CN	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.230.	H	CN	OCH ₃	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.231.	H	CN	OCH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.232.	H	CN	OCH ₃	OCH ₂ C≡CH
I.a.233.	H	CN	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃
I.a.234.	H	CN	OCH ₃	OCH ₂ CHF ₂
I.a.235.	H	CN	OCH ₃	OC ₆ H ₅
I.a.236.	H	CN	OCH ₃	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.237.	H	CN	OCH ₃	OCH ₂ OCH ₃
I.a.238.	H	CN	OCH ₃	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.239.	H	CN	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.240.	H	CN	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.241.	H	CN	OCH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.242.	H	CN	OCH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.243.	H	CN	OCH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.244.	H	CN	OCH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.245.	H	CN	OCH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.246.	H	CN	OCH ₃	OCH ₂ -シクロブチル
I.a.247.	H	CN	OCH ₃	SCH ₃
I.a.248.	H	CN	OCH ₃	SC ₂ H ₅
I.a.249.	H	CN	OCH ₃	NHSO ₂ CH ₃
I.a.250.	H	CN	OCH ₃	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.251.	H	CN	OCH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.252.	H	CN	OCH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.253.	F	F	H	OH
I.a.254.	F	F	H	OCH ₃

10

20

30

40

50

I.a.255.	F	F	H	OC ₂ H ₅
I.a.256.	F	F	H	OCH(CH ₃) ₂
I.a.257.	F	F	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.258.	F	F	H	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.259.	F	F	H	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.260.	F	F	H	OCH ₂ C≡CH
I.a.261.	F	F	H	OCH ₂ CF ₃
I.a.262.	F	F	H	OCH ₂ CHF ₂
I.a.263.	F	F	H	OC ₆ H ₅
I.a.264.	F	F	H	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.265.	F	F	H	OCH ₂ OCH ₃
I.a.266.	F	F	H	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.267.	F	F	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.268.	F	F	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.269.	F	F	H	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.270.	F	F	H	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.271.	F	F	H	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.272.	F	F	H	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.273.	F	F	H	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.274.	F	F	H	OCH ₂ -シクロブチル
I.a.275.	F	F	H	SCH ₃
I.a.276.	F	F	H	SC ₂ H ₅
I.a.277.	F	F	H	NHSO ₂ CH ₃
I.a.278.	F	F	H	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.279.	F	F	H	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.280.	F	F	H	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.281.	F	F	CH ₃	OH
I.a.282.	F	F	CH ₃	OCH ₃
I.a.283.	F	F	CH ₃	OC ₂ H ₅
I.a.284.	F	F	CH ₃	OCH(CH ₃) ₂
I.a.285.	F	F	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.286.	F	F	CH ₃	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.287.	F	F	CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.288.	F	F	CH ₃	OCH ₂ C≡CH
I.a.289.	F	F	CH ₃	OCH ₂ CF ₃
I.a.290.	F	F	CH ₃	OCH ₂ CHF ₂
I.a.291.	F	F	CH ₃	OC ₆ H ₅
I.a.292.	F	F	CH ₃	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.293.	F	F	CH ₃	OCH ₂ OCH ₃
I.a.294.	F	F	CH ₃	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.295.	F	F	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.296.	F	F	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.297.	F	F	CH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₃

10

20

30

40

50

I.a.298.	F	F	CH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.299.	F	F	CH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.300.	F	F	CH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.301.	F	F	CH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.302.	F	F	CH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.303.	F	F	CH ₃	SCH ₃
I.a.304.	F	F	CH ₃	SC ₂ H ₅
I.a.305.	F	F	CH ₃	NHSO ₂ CH ₃
I.a.306.	F	F	CH ₃	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.307.	F	F	CH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.308.	F	F	CH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.309.	F	F	OCH ₃	OH
I.a.310.	F	F	OCH ₃	OCH ₃
I.a.311.	F	F	OCH ₃	OC ₂ H ₅
I.a.312.	F	F	OCH ₃	OCH(CH ₃) ₂
I.a.313.	F	F	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.314.	F	F	OCH ₃	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.315.	F	F	OCH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.316.	F	F	OCH ₃	OCH ₂ C≡CH
I.a.317.	F	F	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃
I.a.318.	F	F	OCH ₃	OCH ₂ CHF ₂
I.a.319.	F	F	OCH ₃	OC ₆ H ₅
I.a.320.	F	F	OCH ₃	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.321.	F	F	OCH ₃	OCH ₂ OCH ₃
I.a.322.	F	F	OCH ₃	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.323.	F	F	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.324.	F	F	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.325.	F	F	OCH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.326.	F	F	OCH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.327.	F	F	OCH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.328.	F	F	OCH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.329.	F	F	OCH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.330.	F	F	OCH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.331.	F	F	OCH ₃	SCH ₃
I.a.332.	F	F	OCH ₃	SC ₂ H ₅
I.a.333.	F	F	OCH ₃	NHSO ₂ CH ₃
I.a.334.	F	F	OCH ₃	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.335.	F	F	OCH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.336.	F	F	OCH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.337.	F	Cl	H	OH
I.a.338.	F	Cl	H	OCH ₃
I.a.339.	F	Cl	H	OC ₂ H ₅
I.a.340.	F	Cl	H	OCH(CH ₃) ₂

10

20

30

40

50

I.a.341.	F	Cl	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.342.	F	Cl	H	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.343.	F	Cl	H	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.344.	F	Cl	H	OCH ₂ C≡CH
I.a.345.	F	Cl	H	OCH ₂ CF ₃
I.a.346.	F	Cl	H	OCH ₂ CHF ₂
I.a.347.	F	Cl	H	OC ₆ H ₅
I.a.348.	F	Cl	H	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.349.	F	Cl	H	OCH ₂ OCH ₃
I.a.350.	F	Cl	H	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.351.	F	Cl	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.352.	F	Cl	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.353.	F	Cl	H	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.354.	F	Cl	H	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.355.	F	Cl	H	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.356.	F	Cl	H	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.357.	F	Cl	H	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.358.	F	Cl	H	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.359.	F	Cl	H	SCH ₃
I.a.360.	F	Cl	H	SC ₂ H ₅
I.a.361.	F	Cl	H	NHSO ₂ CH ₃
I.a.362.	F	Cl	H	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.363.	F	Cl	H	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.364.	F	Cl	H	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.365.	F	Cl	CH ₃	OH
I.a.366.	F	Cl	CH ₃	OCH ₃
I.a.367.	F	Cl	CH ₃	OC ₂ H ₅
I.a.368.	F	Cl	CH ₃	OCH(CH ₃) ₂
I.a.369.	F	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.370.	F	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.371.	F	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.372.	F	Cl	CH ₃	OCH ₂ C≡CH
I.a.373.	F	Cl	CH ₃	OCH ₂ CF ₃
I.a.374.	F	Cl	CH ₃	OCH ₂ CHF ₂
I.a.375.	F	Cl	CH ₃	OC ₆ H ₅
I.a.376.	F	Cl	CH ₃	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.377.	F	Cl	CH ₃	OCH ₂ OCH ₃
I.a.378.	F	Cl	CH ₃	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.379.	F	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.380.	F	Cl	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.381.	F	Cl	CH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.382.	F	Cl	CH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.383.	F	Cl	CH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃

10

20

30

40

50

I.a.384.	F	Cl	CH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.385.	F	Cl	CH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.386.	F	Cl	CH ₃	OCH ₂ -シクロブチル
I.a.387.	F	Cl	CH ₃	SCH ₃
I.a.388.	F	Cl	CH ₃	SC ₂ H ₅
I.a.389.	F	Cl	CH ₃	NHSO ₂ CH ₃
I.a.390.	F	Cl	CH ₃	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.391.	F	Cl	CH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.392.	F	Cl	CH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.393.	F	Cl	OCH ₃	OH
I.a.394.	F	Cl	OCH ₃	OCH ₃
I.a.395.	F	Cl	OCH ₃	OC ₂ H ₅
I.a.396.	F	Cl	OCH ₃	OCH(CH ₃) ₂
I.a.397.	F	Cl	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.398.	F	Cl	OCH ₃	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.399.	F	Cl	OCH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.400.	F	Cl	OCH ₃	OCH ₂ C≡CH
I.a.401.	F	Cl	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃
I.a.402.	F	Cl	OCH ₃	OCH ₂ CHF ₂
I.a.403.	F	Cl	OCH ₃	OC ₆ H ₅
I.a.404.	F	Cl	OCH ₃	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.405.	F	Cl	OCH ₃	OCH ₂ OCH ₃
I.a.406.	F	Cl	OCH ₃	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.407.	F	Cl	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.408.	F	Cl	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.409.	F	Cl	OCH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.410.	F	Cl	OCH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.411.	F	Cl	OCH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.412.	F	Cl	OCH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.413.	F	Cl	OCH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.414.	F	Cl	OCH ₃	OCH ₂ -シクロブチル
I.a.415.	F	Cl	OCH ₃	SCH ₃
I.a.416.	F	Cl	OCH ₃	SC ₂ H ₅
I.a.417.	F	Cl	OCH ₃	NHSO ₂ CH ₃
I.a.418.	F	Cl	OCH ₃	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.419.	F	Cl	OCH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.420.	F	Cl	OCH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.421.	F	CN	H	OH
I.a.422.	F	CN	H	OCH ₃
I.a.423.	F	CN	H	OC ₂ H ₅
I.a.424.	F	CN	H	OCH(CH ₃) ₂
I.a.425.	F	CN	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.426.	F	CN	H	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂

10

20

30

40

50

I.a.427.	F	CN	H	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.428.	F	CN	H	OCH ₂ C≡CH
I.a.429.	F	CN	H	OCH ₂ CF ₃
I.a.430.	F	CN	H	OCH ₂ CHF ₂
I.a.431.	F	CN	H	OC ₆ H ₅
I.a.432.	F	CN	H	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.433.	F	CN	H	OCH ₂ OCH ₃
I.a.434.	F	CN	H	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.435.	F	CN	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.436.	F	CN	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.437.	F	CN	H	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.438.	F	CN	H	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.439.	F	CN	H	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.440.	F	CN	H	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.441.	F	CN	H	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.442.	F	CN	H	OCH ₂ -シクロブチル
I.a.443.	F	CN	H	SC ₆ H ₅
I.a.444.	F	CN	H	SC ₂ H ₅
I.a.445.	F	CN	H	NHSO ₂ CH ₃
I.a.446.	F	CN	H	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.447.	F	CN	H	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.448.	F	CN	H	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.449.	F	CN	CH ₃	OH
I.a.450.	F	CN	CH ₃	OCH ₃
I.a.451.	F	CN	CH ₃	OC ₂ H ₅
I.a.452.	F	CN	CH ₃	OCH(CH ₃) ₂
I.a.453.	F	CN	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.454.	F	CN	CH ₃	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.455.	F	CN	CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.456.	F	CN	CH ₃	OCH ₂ C≡CH
I.a.457.	F	CN	CH ₃	OCH ₂ CF ₃
I.a.458.	F	CN	CH ₃	OCH ₂ CHF ₂
I.a.459.	F	CN	CH ₃	OC ₆ H ₅
I.a.460.	F	CN	CH ₃	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.461.	F	CN	CH ₃	OCH ₂ OCH ₃
I.a.462.	F	CN	CH ₃	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.463.	F	CN	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.464.	F	CN	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.465.	F	CN	CH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.466.	F	CN	CH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.467.	F	CN	CH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.468.	F	CN	CH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.469.	F	CN	CH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル

10

20

30

40

50

I.a.470.	F	CN	CH ₃	OCH ₂ -シクロブチル
I.a.471.	F	CN	CH ₃	SCH ₃
I.a.472.	F	CN	CH ₃	SC ₂ H ₅
I.a.473.	F	CN	CH ₃	NHSO ₂ CH ₃
I.a.474.	F	CN	CH ₃	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.475.	F	CN	CH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.476.	F	CN	CH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.477.	F	CN	OCH ₃	OH
I.a.478.	F	CN	OCH ₃	OCH ₃
I.a.479.	F	CN	OCH ₃	OC ₂ H ₅
I.a.480.	F	CN	OCH ₃	OCH(CH ₃) ₂
I.a.481.	F	CN	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.482.	F	CN	OCH ₃	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.483.	F	CN	OCH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.484.	F	CN	OCH ₃	OCH ₂ C≡CH
I.a.485.	F	CN	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃
I.a.486.	F	CN	OCH ₃	OCH ₂ CHF ₂
I.a.487.	F	CN	OCH ₃	OC ₆ H ₅
I.a.488.	F	CN	OCH ₃	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.489.	F	CN	OCH ₃	OCH ₂ OCH ₃
I.a.490.	F	CN	OCH ₃	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.491.	F	CN	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.492.	F	CN	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.493.	F	CN	OCH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.494.	F	CN	OCH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.495.	F	CN	OCH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.496.	F	CN	OCH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.497.	F	CN	OCH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.498.	F	CN	OCH ₃	OCH ₂ -シクロブチル
I.a.499.	F	CN	OCH ₃	SCH ₃
I.a.500.	F	CN	OCH ₃	SC ₂ H ₅
I.a.501.	F	CN	OCH ₃	NHSO ₂ CH ₃
I.a.502.	F	CN	OCH ₃	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.503.	F	CN	OCH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.504.	F	CN	OCH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.505.	H	Br	H	OH
I.a.506.	H	Br	H	OCH ₃
I.a.507.	H	Br	H	OC ₂ H ₅
I.a.508.	H	Br	H	OCH(CH ₃) ₂
I.a.509.	H	Br	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.510.	H	Br	H	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.511.	H	Br	H	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.512.	H	Br	H	OCH ₂ C≡CH

10

20

30

40

50

I.a.513.	H	Br	H	OCH ₂ CF ₃
I.a.514.	H	Br	H	OCH ₂ CHF ₂
I.a.515.	H	Br	H	OC ₆ H ₅
I.a.516.	H	Br	H	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.517.	H	Br	H	OCH ₂ OCH ₃
I.a.518.	H	Br	H	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.519.	H	Br	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.520.	H	Br	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.521.	H	Br	H	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.522.	H	Br	H	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.523.	H	Br	H	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.524.	H	Br	H	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.525.	H	Br	H	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.526.	H	Br	H	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.527.	H	Br	H	SCH ₃
I.a.528.	H	Br	H	SC ₂ H ₅
I.a.529.	H	Br	H	NHSO ₂ CH ₃
I.a.530.	H	Br	H	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.531.	H	Br	H	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.532.	H	Br	H	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.533.	H	Br	CH ₃	OH
I.a.534.	H	Br	CH ₃	OCH ₃
I.a.535.	H	Br	CH ₃	OC ₂ H ₅
I.a.536.	H	Br	CH ₃	OCH(CH ₃) ₂
I.a.537.	H	Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.538.	H	Br	CH ₃	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.539.	H	Br	CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.540.	H	Br	CH ₃	OCH ₂ C≡CH
I.a.541.	H	Br	CH ₃	OCH ₂ CF ₃
I.a.542.	H	Br	CH ₃	OCH ₂ CHF ₂
I.a.543.	H	Br	CH ₃	OC ₆ H ₅
I.a.544.	H	Br	CH ₃	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.545.	H	Br	CH ₃	OCH ₂ OCH ₃
I.a.546.	H	Br	CH ₃	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.547.	H	Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.548.	H	Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.549.	H	Br	CH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.550.	H	Br	CH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.551.	H	Br	CH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.552.	H	Br	CH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.553.	H	Br	CH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.554.	H	Br	CH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.555.	H	Br	CH ₃	SCH ₃

10

20

30

40

50

I.a.556.	H	Br	CH ₃	SC ₂ H ₅
I.a.557.	H	Br	CH ₃	NHSO ₂ CH ₃
I.a.558.	H	Br	CH ₃	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.559.	H	Br	CH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.560.	H	Br	CH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.561.	H	Br	OCH ₃	OH
I.a.562.	H	Br	OCH ₃	OCH ₃
I.a.563.	H	Br	OCH ₃	OC ₂ H ₅
I.a.564.	H	Br	OCH ₃	OCH(CH ₃) ₂
I.a.565.	H	Br	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.566.	H	Br	OCH ₃	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.567.	H	Br	OCH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.568.	H	Br	OCH ₃	OCH ₂ C≡CH
I.a.569.	H	Br	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃
I.a.570.	H	Br	OCH ₃	OCH ₂ CHF ₂
I.a.571.	H	Br	OCH ₃	OC ₆ H ₅
I.a.572.	H	Br	OCH ₃	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.573.	H	Br	OCH ₃	OCH ₂ OCH ₃
I.a.574.	H	Br	OCH ₃	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.575.	H	Br	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.576.	H	Br	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.577.	H	Br	OCH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.578.	H	Br	OCH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.579.	H	Br	OCH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.580.	H	Br	OCH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.581.	H	Br	OCH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.582.	H	Br	OCH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.583.	H	Br	OCH ₃	SCH ₃
I.a.584.	H	Br	OCH ₃	SC ₂ H ₅
I.a.585.	H	Br	OCH ₃	NHSO ₂ CH ₃
I.a.586.	H	Br	OCH ₃	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.587.	H	Br	OCH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.588.	H	Br	OCH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.589.	F	Br	H	OH
I.a.590.	F	Br	H	OCH ₃
I.a.591.	F	Br	H	OC ₂ H ₅
I.a.592.	F	Br	H	OCH(CH ₃) ₂
I.a.593.	F	Br	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.594.	F	Br	H	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.595.	F	Br	H	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.596.	F	Br	H	OCH ₂ C≡CH
I.a.597.	F	Br	H	OCH ₂ CF ₃
I.a.598.	F	Br	H	OCH ₂ CHF ₂

10

20

30

40

50

I.a.599.	F	Br	H	OC ₆ H ₅
I.a.600.	F	Br	H	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.601.	F	Br	H	OCH ₂ OCH ₃
I.a.602.	F	Br	H	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.603.	F	Br	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.604.	F	Br	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.605.	F	Br	H	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.606.	F	Br	H	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.607.	F	Br	H	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.608.	F	Br	H	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.609.	F	Br	H	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.610.	F	Br	H	OCH ₂ -シクロブチル
I.a.611.	F	Br	H	SCH ₃
I.a.612.	F	Br	H	SC ₂ H ₅
I.a.613.	F	Br	H	NHSO ₂ CH ₃
I.a.614.	F	Br	H	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.615.	F	Br	H	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.616.	F	Br	H	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.617.	F	Br	CH ₃	OH
I.a.618.	F	Br	CH ₃	OCH ₃
I.a.619.	F	Br	CH ₃	OC ₂ H ₅
I.a.620.	F	Br	CH ₃	OCH(CH ₃) ₂
I.a.621.	F	Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.622.	F	Br	CH ₃	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.623.	F	Br	CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.624.	F	Br	CH ₃	OCH ₂ C≡CH
I.a.625.	F	Br	CH ₃	OCH ₂ CF ₃
I.a.626.	F	Br	CH ₃	OCH ₂ CHF ₂
I.a.627.	F	Br	CH ₃	OC ₆ H ₅
I.a.628.	F	Br	CH ₃	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.629.	F	Br	CH ₃	OCH ₂ OCH ₃
I.a.630.	F	Br	CH ₃	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.631.	F	Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.632.	F	Br	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.633.	F	Br	CH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.634.	F	Br	CH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.635.	F	Br	CH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.636.	F	Br	CH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.637.	F	Br	CH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.638.	F	Br	CH ₃	OCH ₂ -シクロブチル
I.a.639.	F	Br	CH ₃	SCH ₃
I.a.640.	F	Br	CH ₃	SC ₂ H ₅
I.a.641.	F	Br	CH ₃	NHSO ₂ CH ₃

10

20

30

40

50

I.a.642.	F	Br	CH ₃	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.643.	F	Br	CH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.644.	F	Br	CH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]
I.a.645.	F	Br	OCH ₃	OH
I.a.646.	F	Br	OCH ₃	OCH ₃
I.a.647.	F	Br	OCH ₃	OC ₂ H ₅
I.a.648.	F	Br	OCH ₃	OCH(CH ₃) ₂
I.a.649.	F	Br	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
I.a.650.	F	Br	OCH ₃	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.651.	F	Br	OCH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
I.a.652.	F	Br	OCH ₃	OCH ₂ C≡CH
I.a.653.	F	Br	OCH ₃	OCH ₂ CF ₃
I.a.654.	F	Br	OCH ₃	OCH ₂ CHF ₂
I.a.655.	F	Br	OCH ₃	OC ₆ H ₅
I.a.656.	F	Br	OCH ₃	OCH ₂ (C ₆ H ₅)
I.a.657.	F	Br	OCH ₃	OCH ₂ OCH ₃
I.a.658.	F	Br	OCH ₃	OCH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.659.	F	Br	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃
I.a.660.	F	Br	OCH ₃	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃
I.a.661.	F	Br	OCH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₃
I.a.662.	F	Br	OCH ₃	OCH ₂ (CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.663.	F	Br	OCH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₃
I.a.664.	F	Br	OCH ₃	OCH(CH ₃)(CO)OCH ₂ CH ₃
I.a.665.	F	Br	OCH ₃	OCH ₂ -シクロプロピル
I.a.666.	F	Br	OCH ₃	OCH ₂ -シクロブチル
I.a.667.	F	Br	OCH ₃	SCH ₃
I.a.668.	F	Br	OCH ₃	SC ₂ H ₅
I.a.669.	F	Br	OCH ₃	NHSO ₂ CH ₃
I.a.670.	F	Br	OCH ₃	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂
I.a.671.	F	Br	OCH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂
I.a.672.	F	Br	OCH ₃	NHSO ₂ N(CH ₃)[CH(CH ₃) ₂]

10

20

30

【0078】

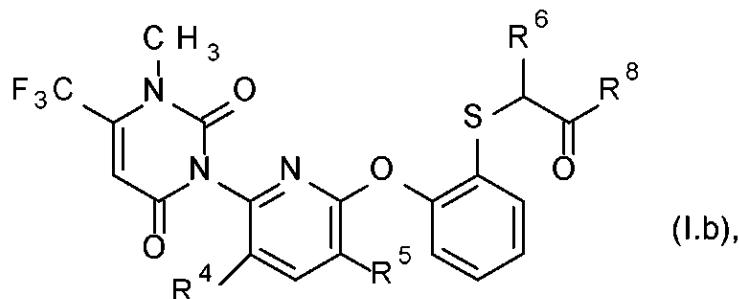
同様に好ましいのは、QがSであるという点においてのみ式(I.a.1)～(I.a.672)の対応するウラシルピリジンと異なる、式(I.b)のウラシルピリジン、好ましくは式(I.b.1)～(I.b.672)のウラシルピリジン、特に好ましいのは、式(I.b.1)～(I.b.504)のウラシルピリジンである：

【0079】

40

50

【化5】



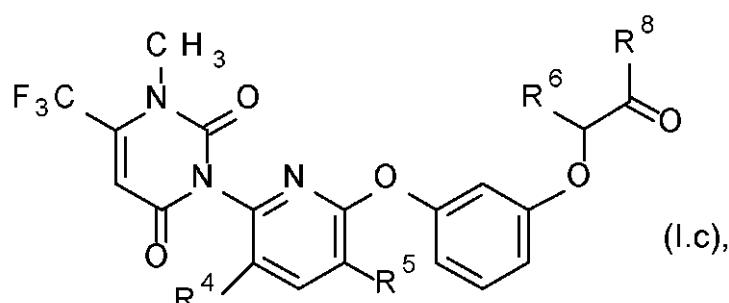
10

【0080】

同様に好ましいのは、ZがZ-2(R^a、R^b、R^c及びR^eは、Hである)であるという点においてのみ式(I.a.1)～(I.a.672)の対応するウラシルピリジンと異なる、式(I.c)のウラシルピリジン、好ましくは式(I.c.1)～(I.c.672)のウラシルピリジン、特に好ましいのは、式(I.c.1)～(I.c.504)のウラシルピリジンである：

【0081】

【化6】



20

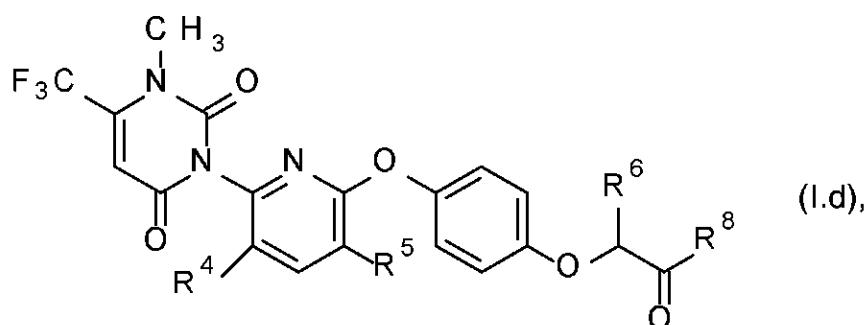
【0082】

同様に好ましいのは、ZがZ-3(R^a、R^b、R^d及びR^eは、Hである)であるという点においてのみ式(I.a.1)～(I.a.672)の対応するウラシルピリジンと異なる、式(I.d)のウラシルピリジン、好ましくは式(I.d.1)～(I.d.672)のウラシルピリジン、特に好ましいのは、式(I.d.1)～(I.d.504)のウラシルピリジンである：

30

【0083】

【化7】



40

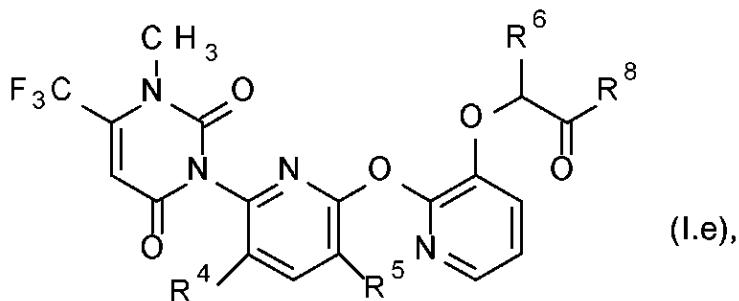
【0084】

同様に好ましいのは、ZがZ-4(R^b、R^c及びR^dは、Hである)であるという点においてのみ式(I.a.1)～(I.a.672)の対応するウラシルピリジンと異なる、式(I.e)のウラシルピリジン、好ましくは式(I.e.1)～(I.e.672)のウラシルピリジン、特に好ましいのは、式(I.e.1)～(I.e.504)のウラシルピリジンである：

【0085】

50

【化 8】



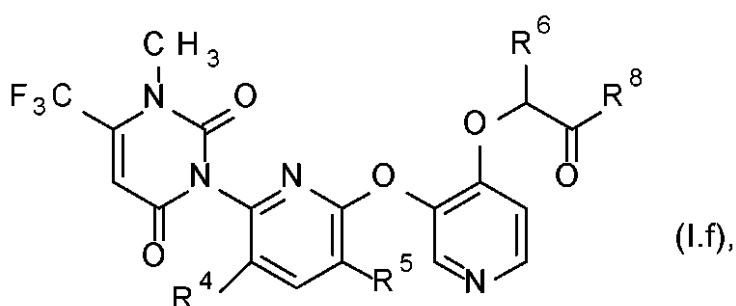
10

【0086】

同様に好ましいのは、ZがZ-5(R^a、R^c及びR^dは、Hである)であるという点においてのみ式(I.a.1)～(I.a.672)の対応するウラシルピリジンと異なる、式(I.f)のウラシルピリジン、好ましくは式(I.f.1)～(I.f.672)のウラシルピリジン、特に好ましいのは、式(I.f.1)～(I.f.504)のウラシルピリジンである：

【0087】

【化 9】



20

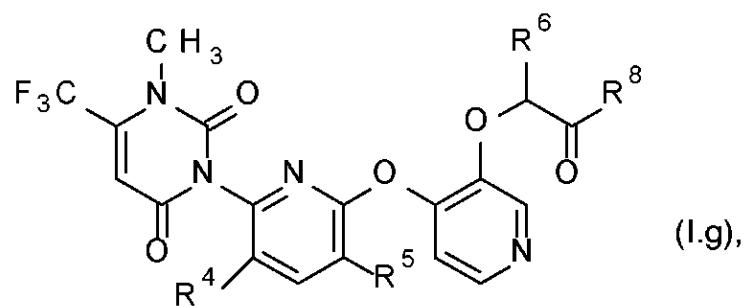
【0088】

同様に好ましいのは、ZがZ-6(R^a、R^b及びR^dは、Hである)であるという点においてのみ式(I.a.1)～(I.a.672)の対応するウラシルピリジンと異なる、式(I.g)のウラシルピリジン、好ましくは式(I.g.1)～(I.g.672)のウラシルピリジン、特に好ましいのは、式(I.g.1)～(I.g.504)のウラシルピリジンである：

30

【0089】

【化 10】



40

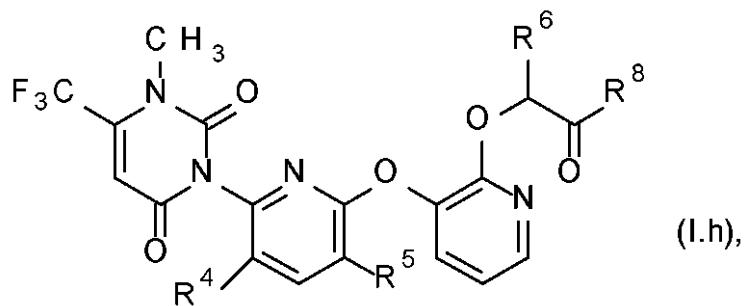
【0090】

同様に好ましいのは、ZがZ-7(R^a、R^b及びR^cは、Hである)であるという点においてのみ式(I.a.1)～(I.a.672)の対応するウラシルピリジンと異なる、式(I.h)のウラシルピリジン、好ましくは式(I.h.1)～(I.h.672)のウラシルピリジン、特に好ましいのは、式(I.h.1)～(I.h.504)のウラシルピリジンである：

【0091】

50

【化11】



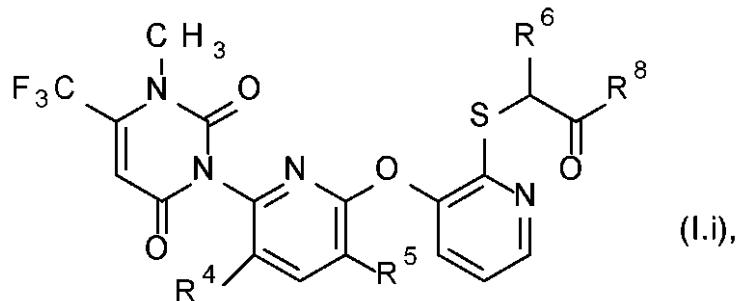
10

【0092】

同様に好ましいのは、ZがZ-7(R^a、R^b及びR^cは、Hであり、Qは、Sである)であるという点においてのみ式(I.a.1)～(I.a.672)の対応するウラシルピリジンと異なる、式(I.i)のウラシルピリジン、好ましくは式(I.i.1)～(I.i.672)のウラシルピリジン、特に好ましいのは、式(I.i.1)～(I.i.504)のウラシルピリジンである：

【0093】

【化12】



20

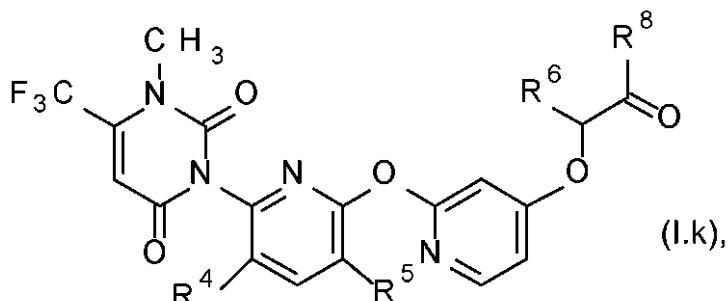
【0094】

同様に好ましいのは、ZがZ-8(R^b、R^c及びR^eは、Hである)であるという点においてのみ式(I.a.1)～(I.a.672)の対応するウラシルピリジンと異なる、式(I.k)のウラシルピリジン、好ましくは式(I.k.1)～(I.k.672)のウラシルピリジン、特に好ましいのは、式(I.k.1)～(I.k.504)のウラシルピリジンである：

30

【0095】

【化13】



40

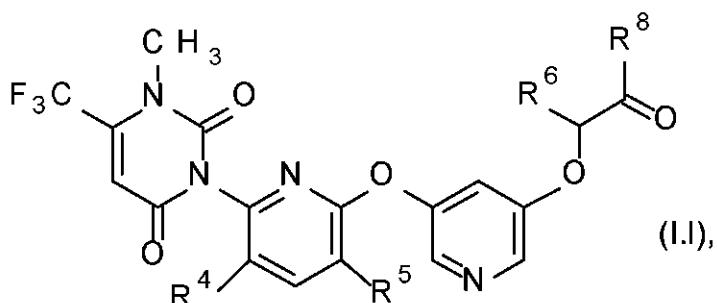
【0096】

同様に好ましいのは、ZがZ-9(R^a、R^c及びR^eは、Hである)であるという点においてのみ式(I.a.1)～(I.a.672)の対応するウラシルピリジンと異なる、式(I.l)のウラシルピリジン、好ましくは式(I.l.1)～(I.l.672)のウラシルピリジン、特に好ましいのは、式(I.l.1)～(I.l.504)のウラシルピリジンである：

【0097】

50

【化14】

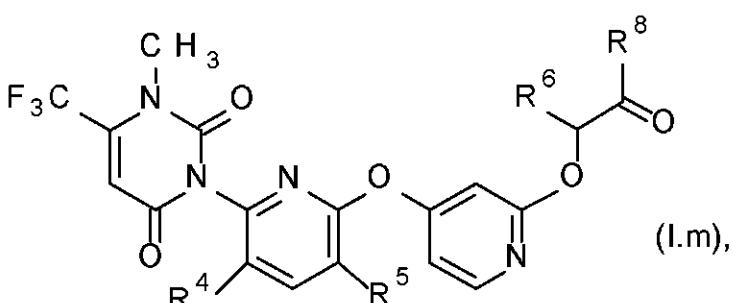


【0098】

同様に好ましいのは、ZがZ-10(R^a、R^b及びR^eは、Hである)であるという点においてのみ式(I.a.1)～(I.a.672)の対応するウラシルピリジンと異なる、式(I.m)のウラシルピリジン、好ましくは式(I.m.1)～(I.m.672)のウラシルピリジン、特に好ましいのは、式(I.m.1)～(I.m.504)のウラシルピリジンである：

【0099】

【化15】

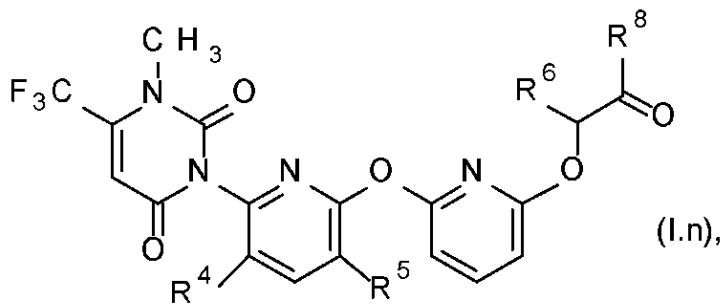


【0100】

同様に好ましいのは、ZがZ-11(R^a、R^b及びR^cは、Hである)であるという点においてのみ式(I.a.1)～(I.a.672)の対応するウラシルピリジンと異なる、式(I.n)のウラシルピリジン、好ましくは式(I.n.1)～(I.n.672)のウラシルピリジン、特に好ましいのは、式(I.n.1)～(I.n.504)のウラシルピリジンである：

【0101】

【化16】



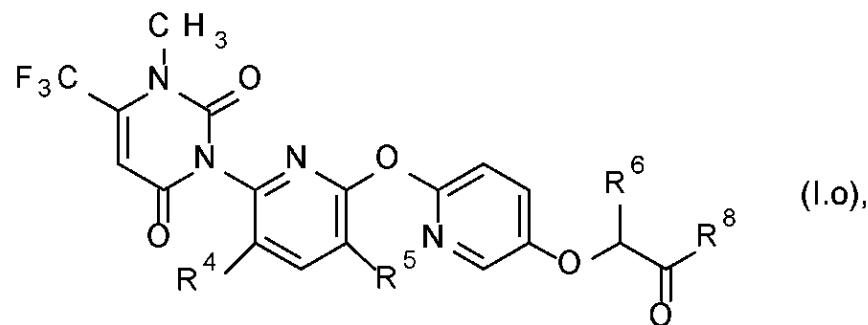
【0102】

同様に好ましいのは、ZがZ-12(R^b、R^d及びR^eは、Hである)であるという点においてのみ式(I.a.1)～(I.a.672)の対応するウラシルピリジンと異なる、式(I.o)のウラシルピリジン、好ましくは式(I.o.1)～(I.o.672)のウラシルピリジン、特に好ましいのは、式(I.o.1)～(I.o.504)のウラシルピリジンである：

【0103】

50

【化 1 7】



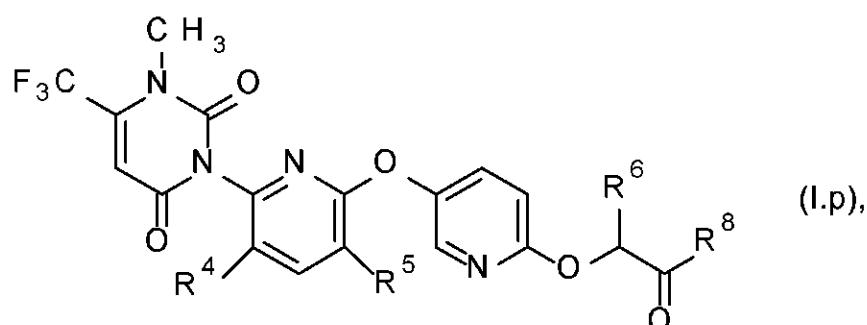
10

[0 1 0 4]

同様に好ましいのは、ZがZ-13(R^a 、 R^d 及び R^e は、Hである)であるという点においてのみ式(I.a.1)～(I.a.672)の対応するウラシルピリジンと異なる、式(I.p)のウラシルピリジン、好ましくは式(I.p.1)～(I.p.672)のウラシルピリジン、特に好ましいのは、式(I.p.1)～(I.p.504)のウラシルピリジンである：

[0 1 0 5]

【化 1 8】



20

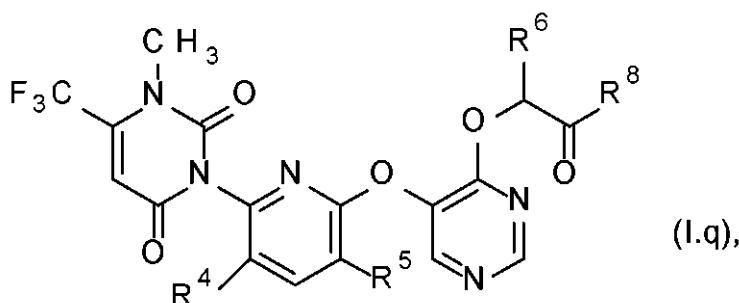
[0 1 0 6]

同様に好ましいのは、ZがZ-21(R^a及びR^cは、Hである)であるという点においてのみ式(I.a.1)～(I.a.672)の対応するウラシルピリジンと異なる、式(I.q)のウラシルピリジン、好ましくは式(I.q.1)～(I.q.672)のウラシルピリジン、特に好ましいのは、式(I.q.1)～(I.q.504)のウラシルピリジンである：

30

[0 1 0 7]

【化 1 9】



40

〔 0 1 0 8 〕

本発明による式(I)のウラシルピリジンは、有機化学の標準的な方法により、例えば、下記のプロセスA～Hによって調製することができる。

(0 1 0 9)

プロセスA)

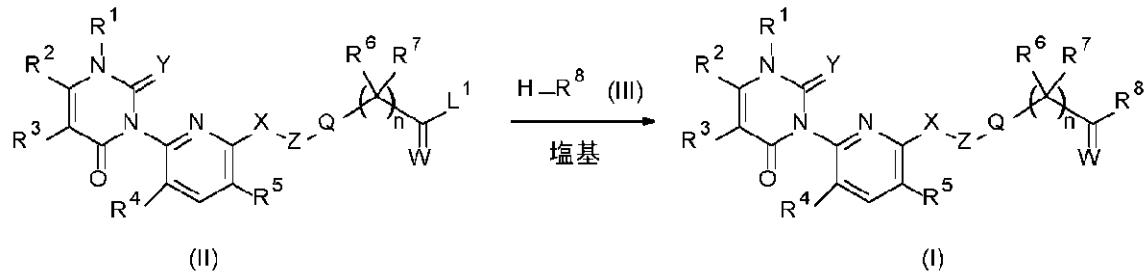
式(1)のウラシルピリジンは、式(11)の酸ハロゲン化物から、塗膜の存在下で、式(11)の

50

化合物との反応により得られる:

【0110】

【化20】



【0111】

式(II)の酸ハロゲン化物内において、 L^1 はハロゲンであり、好ましくはF、Cl又はBrであり、とりわけ好ましくは、F又はClであり、より好ましくはClである。

【0112】

式(II)の酸ハロゲン化物の代わりに、やはり対応する酸(例えば、 L^1 がOHである式(II)の酸ハロゲン化物)を、カルボニルジイミダゾール、N,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド(EDC)又は塩化N-メチル-2-クロロピリドニウムのような活性化試薬と組み合わせて、使用することができる。反応条件は、式(II)の酸ハロゲン化物の場合に記載されるものと同一である。

20

【0113】

化合物(III)はまた、それらの塩、特にナトリウム塩及びカリウム塩の形態で使用することができ、この場合、塩基の存在は必要ではない。

【0114】

酸ハロゲン化物(II)と化合物(III)との反応は、通常、0 ~ 反応混合物の沸点、好ましくは0 ~ 100 で、特に好ましくは0 ~ 40 で、塩基の存在下、不活性有機溶媒中で行われる。

【0115】

反応は、原理上、物質中で行うことができる。しかし、好ましいのは、酸ハロゲン化物(II)と化合物(III)とを有機溶媒中で反応させることである。原理上好適なのは、反応条件下で少なくとも部分的に、及び好ましくは完全に酸ハロゲン化物(II)及び化合物(III)を溶解することが可能な全ての溶媒である。

30

【0116】

好適な溶媒の例は、脂肪族炭化水素(例えばペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン、ニトロメタン及びC₅-C₈-アルカンの混合物)、芳香族炭化水素(例えばベンゼン、クロロベンゼン、トルエン、クレゾール、o-、m-及びp-キシレン)、ハロゲン化炭化水素(例えばジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素及びクロロベンゼン)、エーテル(例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル(TBM E)、ジオキサン、アニソール及びテトラヒドロフラン(THF))、エステル(例えば、酢酸エチル及び酢酸ブチル)、ニトリル(例えば、アセトニトリル及びプロピオニトリル)、ケトン(例えば、アセトン、メチルエチルケトン、ジエチルケトン、tert-ブチルメチルケトン、シクロヘキサン)、双極性非プロトン性溶媒(例えばスルホラン、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド(DMF)、N,N-ジメチルアセトアミド(DMAC)、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン(DMI)、N,N'-ジメチルプロピレン尿素(DMPU)、ジメチルスルホキシド(DMSO)及び1-メチル-2-ピロリジノン(NMP))である。

40

【0117】

好ましい溶媒は、上記のエーテル及び双極性非プロトン性溶媒である。

【0118】

言及した溶媒の混合物を使用することも可能である。

50

【0119】

好適な塩基の例には、金属含有塩基及び窒素含有塩基が含まれる。

【0120】

好適な金属含有塩基の例は、無機化合物(例えばアルカリ金属及びアルカリ土類金属酸化物)、並びに他の金属酸化物(例えば酸化リチウム、酸化ナトリウム、酸化カリウム、酸化マグネシウム、酸化カルシウム及び酸化マグネシウム、酸化鉄、酸化銀)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属水素化物(例えば、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム及び水素化カルシウム)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩(例えば、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸マグネシウム及び炭酸カルシウム)、アルカリ金属の炭酸水素塩(重炭酸塩)(例えば、炭酸水素リチウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属のリン酸塩(例えば、リン酸カリウム、リン酸カルシウム)、及びさらに、有機塩基(例えば、三級アミン、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリブチルアミン及びN-メチルピペリジン、ピリジン、置換ピリジン(例えばコリジン(collidine)、ルチジン、N-メチルモルホリン及び4-ジメチルアミノピリジン)、及びまた二環式アミン)である。

10

【0121】

好適な窒素含有塩基の例は、C1-C6-アルキルアミン、好ましくはトリアルキルアミン、例えばトリエチルアミン、トリメチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン;ピリジン、ルチジン、コリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン(DMAP)、イミダゾール、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン(DBU)又は1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノナ-5-エン(DBN)である。

20

【0122】

好ましい塩基は、上記に定義されるアルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩、並びに窒素含有塩基であり、とりわけ好ましいのはトリエチルアミン、ピリジン又は炭酸ナトリウムである。

【0123】

本明細書中で使用される用語「塩基」はまた、2種以上、好ましくは2種の上記化合物の混合物も包含する。特に好ましいのは、1種の塩基の使用である。

【0124】

塩基は、一般的には過剰で、より好ましくは酸ハロゲン化物(II)に対して1~3当量で使用され、これらは溶媒として使用することもできる。

30

【0125】

この反応の場合、酸ハロゲン化物(II)、化合物(III)及び塩基は、それら自体が任意の方法で接觸することができる。

【0126】

従って、この反応のパートナー及び塩基は、反応容器に導入されて、個別に、同時に又は逐次に反応させることができる。

【0127】

反応剤は、一般的には等モル量で、使用される。例えば、他の反応剤との反応を完了させるという観点で、反応剤の1つを過剰で使用すると有利となることがある。

40

【0128】

反応は、大気圧、減圧又は昇圧下で、適切であれば不活性ガス下で、連続的に又はバッチ法で行うことができる。

【0129】

反応の終了は、当業者が常法により容易に決定することができる。

【0130】

反応混合物は、慣用の様式で、例えば、水との混合、相の分離及び、適切であれば、粗生成物のクロマトグラフィー精製により後処理される。

【0131】

いくつかの中間体及び最終生成物は、粘性の油状物の形態で得られ、これを精製するこ

50

ともできるし、減圧下に適度な昇温で揮発性成分を除去することもできる。

【0132】

中間体及び最終生成物が固体として得られる場合、精製は、再結晶又は温浸によって行うこともできる。

【0133】

式(III)の化合物は、市販されている。

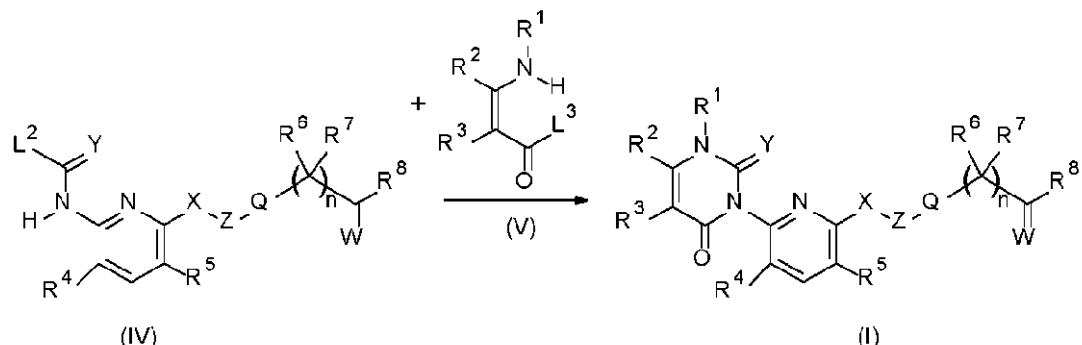
【0134】

プロセスB)

代替として、式(I)のウラシルピリジンは、式(IV)の(チオ)カルバメートと式(V)のエナミンとを反応させることによって調製することができる:

【0135】

【化21】



【0136】

式(IV)の(チオ)カルバメート内では、L²は、求核的に置換可能な脱離基、

好ましくはC₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ又はアリールオキシ(アリール部分は、それ自体、部分的に若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、並びに/又はシアノ、ニトロ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-アルキルチオの群からの1~3個の置換基により置換されていてもよい);

特に、好ましくはC₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ又はフェニルオキシ(フェニル部分は、それ自体、部分的に若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、並びに/又はシアノ、ニトロ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-アルキルチオの群からの1~3つの基により置換されていてもよい);

より好ましくは、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ又はフェニルオキシ;

最も好ましくは、C₁-C₆-アルコキシ

である。

【0137】

式(V)のエナミン内において、L³は、求核的に置換可能な脱離基、

好ましくは、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₄-アルコキシ-C₂-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-アルキルチオ-C₂-C₄-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルケニルオキシ、C₃-C₆-アルキニルオキシ、C₃-C₆-ハロアルキニルオキシ、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₁-C₆-シアノアルコキシ又はベンジルオキシ(ベンジル環は、それ自体、部分的に若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、並びに/又はシアノ、ニトロ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-アルキルチオの群から選択される1~3個の置換基により置換されていてもよい);

特に、好ましくは、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₄-アルコキシ-C₂-C₄-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルケニルオキシ、C₃-C₆-アルキニルオキシ又はC₃-C₆-ハロアルキニルオキシ;

とりわけ好ましくは、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₄-アルコキシ-C₂-C₄-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニルオキシ又はC₃-C₆-アルキニルオキシ;

10

20

30

40

50

より好ましくは、C₁-C₆-アルコキシである。

【0138】

この反応の好ましい実施形態において、R¹は、水素、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-アルキニル；好ましくは、水素又はC₁-C₆-アルキル、最も好ましくは水素である。

【0139】

式(IV)の(チオ)カルバメートと式(V)のエナミンとの反応は、通常、室温より高い温度、例えば、25 ~ 200、好ましくは90 ~ 190、より好ましくは100 ~ 140で、
10 塩基の存在下、不活性有機溶媒中で行われる(例えば、WO 99/31091、WO 11/05793
5)。

【0140】

好適な溶媒は、脂肪族炭化水素(例えば、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン、及びC₅-C₁₂-アルカンの混合物)、芳香族炭化水素(例えば、トルエン、o-、m-及びp-キシレン)、ハロゲン化炭化水素(例えば、塩化メチレン、クロロホルム及びクロロベンゼン)、エーテル(例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、ジオキサン、ジエチレングリコールジメチルエーテル、アニソール及びテトラヒドロフラン)、ニトリル(例えば、アセトニトリル及びプロピオニトリル)、アルコール(例えば、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロパノール、n-ブタノール及びtert-ブタノール)、カルボン酸エステル(例えば、酢酸ブチル)、並びにまたジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド及びN-メチルピロリドンである。

【0141】

好ましい溶媒は、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド及びN-メチルピロリドンである。

【0142】

言及した溶媒の混合物を使用することも可能である。

【0143】

有用な塩基は、一般的に、無機化合物、例えばアルカリ金属及びアルカリ土類金属の水酸化物(例えば、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム及び水酸化カルシウム)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属酸化物(例えば、酸化リチウム、酸化ナトリウム、酸化カルシウム及び酸化マグネシウム)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属水素化物(例えば、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム及び水素化カルシウム)、アルカリ金属アミド(例えば、リチウムアミド、ナトリウムアミド及びカリウムアミド)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩(例えば、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸カルシウム及び炭酸セシウム)、及びまたアルカリ金属の炭酸水素塩(例えば、炭酸水素ナトリウム)、有機金属化合物、とりわけアルキルアルカリ金属(例えば、メチルリチウム、ブチルリチウム及びフェニルリチウム)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属のアルコキシド(例えば、リチウムメトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシド、カリウムtert-ペントキシド及びジメトキシマグネシウム)、及びまた有機塩基、例えば三級アミン(例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン及びN-メチルピペリジン)、ピリジン、置換ピリジン(例えば、コリジン、ルチジン及び4-ジメチルアミノピリジン)、及びまた二環式アミンである。

【0144】

特に好ましいのは、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の水酸化物、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩、並びにまたアルカリ金属及びアルカリ土類金属のアルコキシドである。

【0145】

塩基は、式(IV)の(チオ)カルバメートに対して、一般的には過剰で使用され、これらは

10

20

30

40

50

溶媒として使用することもできる。ある期間にわたり、補正塩基(base offset)を加えるのが有利であり得る。

【0146】

反応混合物は、慣用の様式で、例えば、水との混合、相の分離及び、適切であれば、粗生成物のクロマトグラフィー精製により後処理される。

【0147】

粘性の油状物の形態で得られる化合物は、精製することもできるし、減圧下及び適度な昇温で揮発性成分を除去することもできる。

【0148】

最終生成物が固体として得られる場合、精製は、再結晶又は温浸によって行うこともできる。

10

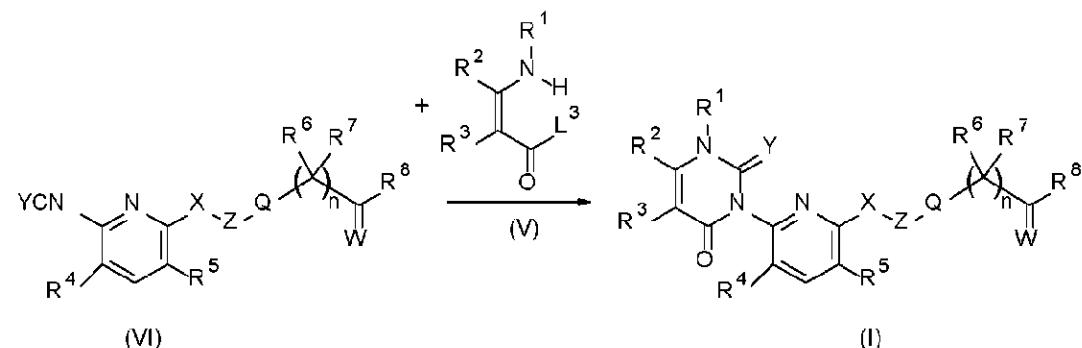
【0149】

プロセスC)

代替として、式(I)のウラシルピリジンは、式(VI)のイソ(チオ)シアネートと式(V)のエナミンとを反応させることによって調製することもできる:

【0150】

【化22】



【0151】

式(V)のエナミン内において、L³は、上記(プロセスB)のとおり定義される。

【0152】

式(VI)のイソ(チオ)シアネートと式(V)のエナミンとの反応は、通常、-20 ~ 80 で、塩基の存在下、不活性有機溶媒中で行われる(例えば、WO 05/054208)。

30

【0153】

好適な溶媒は、脂肪族炭化水素(例えば、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン、及びC₅-C₁₂-アルカンの混合物)、芳香族炭化水素(例えば、トルエン、o-、m-及びp-キシレン)、ハロゲン化炭化水素(例えば、塩化メチレン、クロロホルム及びクロロベンゼン)、エーテル(例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、ジオキサン、ジエチレングリコールジメチルエーテル、アニソール及びテトラヒドロフラン)、ニトリル(例えば、アセトニトリル及びプロピオニトリル)、アルコール(例えば、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロパノール、n-ブタノール及びtert-ブタノール)、カルボン酸エステル(例えば、酢酸ブチル)、並びにまたジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド及びN-メチルピロリドンである。

40

【0154】

好ましい溶媒は、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド及びN-メチルピロリドンである。

【0155】

言及した溶媒の混合物を使用することも可能である。

【0156】

有用な塩基は、一般的に、無機化合物、例えばアルカリ金属及びアルカリ土類金属の水酸化物(例えば、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム及び水酸化カルシウム)

50

ム)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属酸化物(例えば、酸化リチウム、酸化ナトリウム、酸化カルシウム及び酸化マグネシウム)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属水素化物(例えば、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム及び水素化カルシウム)、アルカリ金属アミド(例えば、リチウムアミド、ナトリウムアミド及びカリウムアミド)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩(例えば、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸カルシウム及び炭酸セシウム)、並びにまたアルカリ金属の炭酸水素塩(例えば、炭酸水素ナトリウム)、有機金属化合物、とりわけアルキルアルカリ金属(例えば、メチルリチウム、ブチルリチウム及びフェニルリチウム)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属のアルコキシド(例えば、リチウムメトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシド、カリウムtert-ペントキシド及びジメトキシマグネシウム)、並びにまた有機塩基、例えば三級アミン(例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン及びN-メチルピペリジン)、ピリジン、置換ピリジン(例えば、コリジン、ルチジン及び4-ジメチルアミノピリジン)、並びにまた二環式アミンである。

【0157】

特に好ましいのは、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の水酸化物、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩、並びにまたアルカリ金属及びアルカリ土類金属のアルコキシドである。

【0158】

塩基は、式(VI)のイソ(チオ)シアネートに対して、一般的には過剰で使用され、これらは溶媒として使用することもできる。

【0159】

ある期間にわたり、補正塩基を加えるのが有利であり得る。

【0160】

反応混合物は、慣用の様式で、例えば、水との混合、相の分離及び、適切であれば、粗生成物のクロマトグラフィー精製により後処理される。

【0161】

粘性の油状物の形態で得られる化合物は、精製することもできるし、減圧下及び適度な昇温で揮発性成分を除去することもできる。

【0162】

最終生成物が固体として得られる場合、精製は、再結晶又は温浸によって行うことができる。

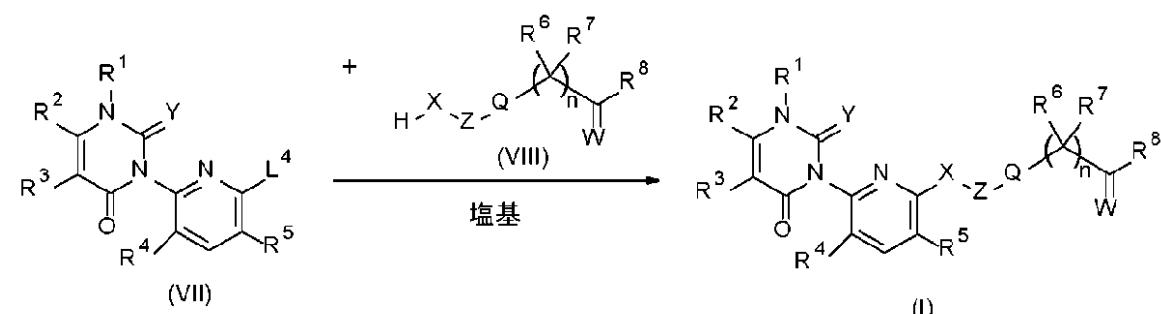
【0163】

プロセスD)

代替として、式(I)のウラシルピリジンは、式(VII)の化合物と式(VIII)の化合物とを塩基の存在下で反応させることによって調製することもできる:

【0164】

【化23】



【0165】

式(VII)の化合物内において、 L^4 は、ハロゲン、C₁-C₆-アルキルスルホネート又はアリ

10

20

30

40

50

ールスルホネート、好ましくは、F、Cl、C₁-C₆-アルキルスルホネート又はアリールスルホネート、とりわけ好ましくは、F、Cl、メシレート又はトシレート、より好ましくはF又はClなどの脱離基である。

【0166】

反応は、原理上、物質中で行うことができる。しかし、好ましいのは、式(VII)の化合物と式(VIII)の化合物とを有機溶媒中で反応させることである。

【0167】

原理上好適なのは、式(VII)の化合物及び式(VIII)の化合物を、反応条件下で少なくとも部分的に、好ましくは完全に溶解することができる全ての溶媒である。

【0168】

好適な溶媒の例は、脂肪族炭化水素(例えばペントン、ヘキサン、シクロヘキサン、ニトロメタン及びC₅-C₈-アルカンの混合物)、芳香族炭化水素(例えばベンゼン、クロロベンゼン、トレン、クレゾール、o-、m-及びp-キシレン)、ハロゲン化炭化水素(例えばジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素及びクロロベンゼン)、エーテル(例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル(TBME)、ジオキサン、アニソール及びテトラヒドロフラン(THF))、エステル(例えば酢酸エチル及び酢酸ブチル)、ニトリル(例えばアセトニトリル及びプロピオニトリル)、ケトン(例えば、アセトン、メチルエチルケトン、ジエチルケトン、tert-ブチルメチルケトン、シクロヘキサン)、並びに双極性非プロトン性溶媒(例えばスルホラン、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド(DMF)、N,N-ジメチルアセトアミド(DMAC)、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン(DMI)、N,N'-ジメチルプロピレン尿素(DMPU)、ジメチルスルホキシド(DMSO)及び1-メチル-2-ピロリジノン(NMP))である。

10

【0169】

好ましい溶媒は、上記のエーテル、ニトリル、ケトン及び双極性非プロトン性溶媒である。

【0170】

より好ましい溶媒は、上記のエーテル及び双極性非プロトン性溶媒である。

【0171】

言及した溶媒の混合物を使用することも可能である。

【0172】

30

好適な塩基の例には、金属含有塩基及び窒素含有塩基が含まれる。

【0173】

好適な金属含有塩基の例は、無機化合物、例えばアルカリ金属及びアルカリ土類金属の水酸化物、並びに他の金属水酸化物(例えば、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化マグネシウム、水酸化カルシウム及び水酸化アルミニウム)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属酸化物、並びに他の金属酸化物(例えば、酸化リチウム、酸化ナトリウム、酸化カリウム、酸化マグネシウム、酸化カルシウム及び酸化マグネシウム、酸化鉄、酸化銀)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属水素化物(例えば、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム及び水素化カルシウム)、アルカリ金属アミド(例えば、リチウムアミド、ナトリウムアミド及びカリウムアミド)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩(例えば、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸マグネシウム及び炭酸カルシウム)、並びにアルカリ金属の炭酸水素塩(重炭酸塩)(例えば、炭酸水素リチウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属のリン酸塩(例えば、リン酸カリウム、リン酸カルシウム)、有機金属化合物、好ましくはアルキルアルカリ金属(例えば、メチルリチウム、ブチルリチウム及びフェニルリチウム)、ハロゲン化アルキルマグネシウム(例えば、塩化メチルマグネシウム)、並びにアルカリ金属及びアルカリ土類金属のアルコキシド(例えば、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシド、カリウムtert-ペントキシド及びジメトキシマグネシウム)、並びにさらに有機塩基、例えば三級アミン(例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン及びN-メチルピペリジン)、

40

50

ピリジン、置換ピリジン(例えば、コリジンジ、ルチジン、N-メチルモルホリン及び4-ジメチルアミノピリジン)、並びにまた二環式アミンである。

〔 0 1 7 4 〕

好適な窒素含有塩基の例は、C₁-C₆-アルキルアミン、好ましくはトリアルキルアミン(例えはトリエチルアミン、トリメチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン)、アンモニア、ピリジン、ルチジン、コリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン(DMAP)、イミダゾール、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン(DBU)又は1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノナ-5-エン(DBN)である、

【 0 1 7 5 】

好ましい塩基は、アルカリ金属及びアルカリ土類金属水素化物、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩、並びにアルカリ金属の炭酸水素塩(重炭酸塩)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属のリン酸塩、有機金属化合物、ハロゲン化アルキルマグネシウム、並びにアルカリ金属及びアルカリ土類金属のアルコキシド、及びさらに有機塩基、例えば、三級アミン、ピリジン、置換ピリジン、及びまた二環式アミンである。

〔 0 1 7 6 〕

とりわけ好ましい塩基は、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩、有機金属化合物、ハロゲン化アルキルマグネシウム、並びにアルカリ金属及びアルカリ土類金属のアルコキシド、及びさらに有機塩基、例えば、三級アミン、ピリジン、置換ピリジン、並びにまた二環式アミンである。

〔 0 1 7 7 〕

本明細書中で使用される用語「塩基」はまた、2種以上、好ましくは2種の上記化合物の混合物も包含する。特に好ましいのは、1種の塩基の使用である。

〔 0 1 7 8 〕

塩基は、一般的には、等モル量又は過剰で用いられるが、これらはまた、溶媒として、又は適切であれば、触媒量で使用することもできる。

〔 0 1 7 9 〕

塩基は、一般的には過剰で、より好ましくは式(VIII)の化合物に対して1~20モル当量で使用され、これらは溶媒として使用することもできる。

[0 1 8 0]

好ましくは、塩基は、式(VIII)の化合物に対して、1~5モル当量、非常に好ましくは1~3モル当量、より好ましくは1~2モル当量で使用される。

〔 0 1 8 1 〕

ある期間にわたり、補正塩基を加えるのが有利であり得る。

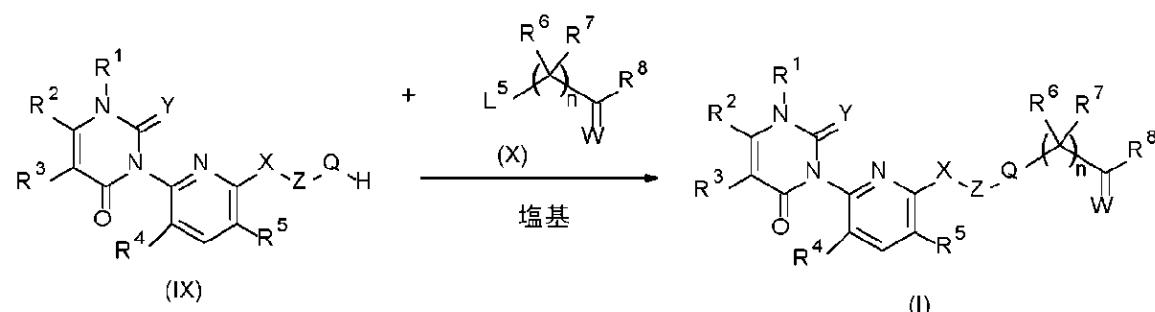
〔 0 1 8 2 〕

プロセスE)

代替として、式(I)のウラシルピリジンは、公知の方法(例えば、WO 11/137088)と同様に、式(IX)の化合物と式(X)のアルキル化剤とを塩基の存在下で反応させることによって調製することもできる:

[0 1 8 3]

【化 2 4】



【0184】

式(X)のアルキル化剤内において、L⁵は、ハロゲン、C₁-C₆-アルキルスルホネート又はアリールスルホネート、好ましくは、Cl、Br,I、C₁-C₆-アルキルスルホネート又はアリールスルホネート、とりわけ好ましくは、Cl、Br又はI、より好ましくはCl又はBrなどの脱離基である。

【0185】

反応は、原理上、物質中で行うことができる。しかし、好ましいのは、式(IX)の化合物と式(X)のアルキル化剤とを有機溶媒中で反応させることである。

【0186】

原理上好適なのは、式(IX)の化合物と式(X)のアルキル化剤を、反応条件下で少なくとも部分的に、好ましくは完全に溶解することができる全ての溶媒である。 10

【0187】

好適な溶媒の例は、脂肪族炭化水素(例えばペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン、ニトロメタン及びC₅-C₈-アルカンの混合物)、芳香族炭化水素(例えばベンゼン、クロロベンゼン、トレン、クレゾール、o-、m-及びp-キシレン)、ハロゲン化炭化水素(例えばジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素及びクロロベンゼン)、エーテル(例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル(TBME)、ジオキサン、アニソール及びテトラヒドロフラン(THF))、エステル(例えば酢酸エチル及び酢酸ブチル)、ニトリル(例えばアセトニトリル及びプロピオニトリル)、ケトン(例えば、アセトン、メチルエチルケトン、ジエチルケトン、tert-ブチルメチルケトン、シクロヘキサン)、並びに双極性非プロトン性溶媒(例えばスルホラン、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド(DMF)、N,N-ジメチルアセトアミド(DMAC)、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン(DMI)、N,N'-ジメチルプロピレン尿素(DMPU)、ジメチルスルホキシド(DMSO)及び1-メチル-2-ピロリジノン(NMP))である。 20

【0188】

好ましい溶媒は、上記のエーテル、ニトリル、ケトン及び双極性非プロトン性溶媒である。

【0189】

より好ましい溶媒は、上記のエーテル及び双極性非プロトン性溶媒である。

【0190】

言及した溶媒の混合物を使用することも可能である。 30

【0191】

好適な塩基の例には、金属含有塩基及び窒素含有塩基が含まれる。

【0192】

好適な金属含有塩基の例は、無機化合物、例えばアルカリ金属及びアルカリ土類金属の水酸化物、並びに他の金属水酸化物(例えば、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化マグネシウム、水酸化カルシウム及び水酸化アルミニウム)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属酸化物、並びに他の金属酸化物(例えば、酸化リチウム、酸化ナトリウム、酸化カリウム、酸化マグネシウム、酸化カルシウム及び酸化マグネシウム、酸化鉄、酸化銀)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属水素化物(例えば、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム及び水素化カルシウム)、アルカリ金属アミド(例えば、リチウムアミド、ナトリウムアミド及びカリウムアミド)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩(例えば、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸マグネシウム及び炭酸カルシウム)、並びにアルカリ金属の炭酸水素塩(重炭酸塩)(例えば、炭酸水素リチウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属のリン酸塩(例えば、リン酸カリウム、リン酸カルシウム)、有機金属化合物、好ましくはアルキルアルカリ金属(例えば、メチルリチウム、ブチルリチウム及びフェニルリチウム)、ハロゲン化アルキルマグネシウム(例えば、塩化メチルマグネシウム)、並びにアルカリ金属及びアルカリ土類金属のアルコキシド(例えば、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシド、カリウムtert-ペントキシド及 40

ビジメトキシマグネシウム)、並びにまた有機塩基、例えば三級アミン(例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン及びN-メチルピペリジン)、ピリジン、置換ピリジン(例えば、コリジン、ルチジン、N-メチルモルホリン及び4-ジメチルアミノピリジン)、並びにまた二環式アミンである。

【0193】

好適な窒素含有塩基の例は、C₁-C₆-アルキルアミン、好ましくは、トリアルキルアミン(例えばトリエチルアミン、トリメチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン)、アンモニア、ピリジン、ルチジン、コリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン(DMAP)、イミダゾール、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン(DBU)又は1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノナ-5-エン(DBN)である。

10

【0194】

好ましい塩基は、アルカリ金属及びアルカリ土類金属水素化物、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩、並びにアルカリ金属の炭酸水素塩(重炭酸塩)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属のリン酸塩、有機金属化合物、ハロゲン化アルキルマグネシウム、並びにアルカリ金属及びアルカリ土類金属のアルコキシド、及びさらに有機塩基、例えば、三級アミン、ピリジン、置換ピリジン、及びまた二環式アミンである。

【0195】

とりわけ好ましい塩基は、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩、有機金属化合物、ハロゲン化アルキルマグネシウム、並びにアルカリ金属及びアルカリ土類金属のアルコキシド、及びさらに有機塩基、例えば、三級アミン、ピリジン、置換ピリジン、及びまた二環式アミンである。

20

【0196】

本明細書中で使用される用語「塩基」はまた、2種以上、好ましくは2種の上記化合物の混合物も包含する。特に好ましいのは、1種の塩基の使用である。

【0197】

塩基は、一般的には、等モル量で又は過剰で、より好ましくは式(IX)の化合物に対して1~20モル当量で使用され、これらは溶媒として使用することもできる。

【0198】

塩基は、式(IX)の化合物に対して、好ましくは1~5モル当量、非常に好ましくは1~3モル当量、より好ましくは1~2モル当量で使用される。

30

【0199】

ある期間にわたり、補正塩基を加えるのが有利であり得る。

【0200】

式(X)のアルキル化剤は市販されているか、又は公知の方法(例えば、Lowell、Andrew N.ら、*Tetrahedron*、6巻(30号)、5573~5582頁、2010年; WO 11/137088)によつて調製することができる。

【0201】

プロセスF)

代替として、R¹がNH₂、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-アルキニルである、式(I)のウラシルピリジンは、R¹がHである式(I)のウラシルピリジンのアミノ化又はアルキル化により調製することができる。

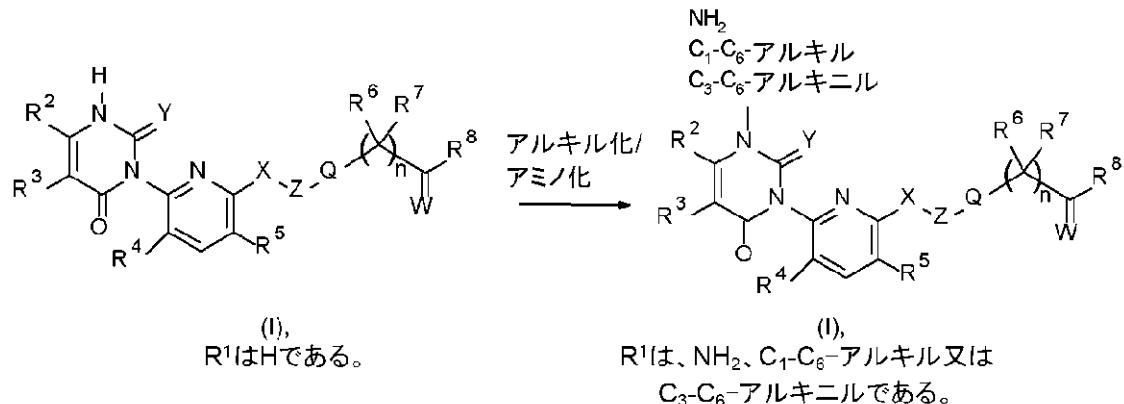
40

【0202】

40

50

【化25】



10

【0203】

そのようなアミノ化又はアルキル化は、公知の方法(例えば、WO 05/054208、WO 06/125746)と同様に行うことができる。

【0204】

反応は、原理上、物質中で行うことができる。しかし、好ましいのは、R¹がHである、式(I)のウラシルピリジンを有機溶媒中で反応させることである。

20

【0205】

原理上好適なのは、R¹がHである、式(I)のウラシルピリジンを、反応条件下で少なくとも部分的に、好ましくは完全に溶解することができる全ての溶媒である。

【0206】

好適な溶媒の例は、脂肪族炭化水素(例えばペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン、ニトロメタン及びC₅-C₈-アルカンの混合物)、芳香族炭化水素(例えばベンゼン、クロロベンゼン、トレン、クレゾール、o-、m-及びp-キシレン)、ハロゲン化炭化水素(例えばジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素及びクロロベンゼン)、エーテル(例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル(TBME)、ジオキサン、アニソール及びテトラヒドロフラン(THF))、エステル(例えば酢酸エチル及び酢酸ブチル)、ニトリル(例えばアセトニトリル及びプロピオニトリル)、ケトン(例えば、アセトン、メチルエチルケトン、ジエチルケトン、tert-ブチルメチルケトン、シクロヘキサン)、並びに双極性非プロトン性溶媒(例えばスルホラン、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド(DMF)、N,N-ジメチルアセトアミド(DMAC)、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン(DMI)、N,N'-ジメチルプロピレン尿素(DMPU)、ジメチルスルホキシド(DMSO)及び1-メチル-2-ピロリジノン(NMP))である。

30

【0207】

好ましい溶媒は、上記のエーテル、ニトリル、ケトン及び双極性非プロトン性溶媒である。

【0208】

より好ましい溶媒は、上記のエーテル及び双極性非プロトン性溶媒である。

40

【0209】

言及した溶媒の混合物を使用することも可能である。

【0210】

好適な塩基の例には、金属含有塩基及び窒素含有塩基が含まれる。

【0211】

好適な金属含有塩基の例は、無機化合物、例えばアルカリ金属及びアルカリ土類金属の水酸化物、並びに他の金属水酸化物(例えば、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化マグネシウム、水酸化カルシウム及び水酸化アルミニウム)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属酸化物、並びに他の金属酸化物(例えば、酸化リチウム、酸化ナトリウム、酸化カリウム、酸化マグネシウム、酸化カルシウム及び酸化マグネシウム、酸化

50

鉄、酸化銀)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属水素化物(例えば、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム及び水素化カルシウム)、アルカリ金属アミド(例えば、リチウムアミド、ナトリウムアミド及びカリウムアミド)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩(例えば、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸マグネシウム及び炭酸カルシウム)、並びにアルカリ金属の炭酸水素塩(重炭酸塩)(例えば、炭酸水素リチウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属のリン酸塩(例えば、リン酸カリウム、リン酸カルシウム)、有機金属化合物、好ましくはアルキルアルカリ金属(例えば、メチルリチウム、ブチルリチウム及びフェニルリチウム)、ハロゲン化アルキルマグネシウム(例えば、塩化メチルマグネシウム)、並びにアルカリ金属及びアルカリ土類金属のアルコキシド(例えば、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシド、カリウムtert-ペントキシド及びジメトキシマグネシウム)、及びさらに有機塩基、例えば三級アミン、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン及びN-メチルピペリジン、ピリジン、置換ピリジン、(例えば、コリジン、ルチジン、N-メチルモルホリン及び4-ジメチルアミノピリジン)、並びにまた二環式アミンである。

【0212】

好適な窒素含有塩基の例は、C₁-C₆-アルキルアミン、好ましくは、トリアルキルアミン(例えばトリエチルアミン、トリメチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン)、アンモニア、ピリジン、ルチジン、コリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン(DMAP)、イミダゾール、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン(DBU)又は1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノナ-5-エン(DBN)である。

【0213】

好ましい塩基は、アルカリ金属及びアルカリ土類金属水素化物、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩、並びにアルカリ金属の炭酸水素塩(重炭酸塩)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属のリン酸塩、有機金属化合物、ハロゲン化アルキルマグネシウム、並びにアルカリ金属及びアルカリ土類金属のアルコキシド、及びさらに有機塩基、例えば、三級アミン、ピリジン、置換ピリジン、及びまた二環式アミンである。

【0214】

とりわけ好ましい塩基は、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩、有機金属化合物、ハロゲン化アルキルマグネシウム、並びにアルカリ金属及びアルカリ土類金属のアルコキシド、及びさらに有機塩基、例えば、三級アミン、ピリジン、置換ピリジン、及びまた二環式アミンである。

【0215】

本明細書中で使用される用語「塩基」はまた、2種以上、好ましくは2種の上記化合物の混合物も包含する。特に好ましいのは、1種の塩基の使用である。

【0216】

塩基は、一般的には、等モル量で又は過剰で、より好ましくはR¹がHである、式(I)のウラシルピリジンに対して、1~20モル当量で使用され、これらは溶媒として使用することもできる。

【0217】

塩基は、R¹がHである、式(I)のウラシルピリジンに対して、好ましくは1~5モル当量、非常に好ましくは1~3モル当量、より好ましくは1~2モル当量で使用される。

【0218】

ある期間にわたり、補正塩基を加えるのが有利であり得る。

【0219】

アルキル化試薬として、市販のC₁-C₆-アルキルハライド及びアルキニルハライド(alkinylhalide)を使用することができる。

【0220】

好適なアミノ化試薬は、文献から公知である(例えば、US 6,333,296又はDE 10005284)。

10

20

30

40

50

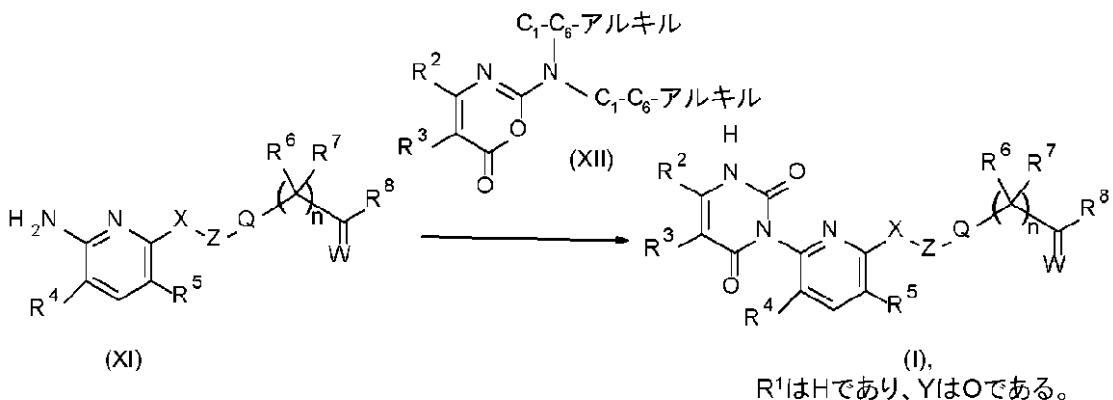
【 0 2 2 1 】

プロセスG)

代替として、R¹がHであり、YがOである、式(I)のウラシルピリジンは、酸の存在下で、式(XI)のアミンと式(XII)のオキサジノンとの反応により調製することができる：

【 0 2 2 2 】

【化 2 6】



〔 0 2 2 3 〕

反応は、原理上、物質中で行うことができる。しかし、好ましいのは、式(XI)のアミンと式(XII)のオキサジノンとを有機溶媒中で反応させることである。

【 0 2 2 4 】

原理上好適なのは、反応条件下で少なくとも部分的に、及び好ましくは完全に式(XI)のアミン及び式(XII)のオキサジノンを溶解することが可能な全ての溶媒である。

【 0 2 2 5 】

好適な溶媒の例は、脂肪族炭化水素(例えばペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン、二トロメタン及びC₅-C₈-アルカンの混合物)、芳香族炭化水素(例えばベンゼン、クロロベンゼン、トレン、クレゾール、o-、m-及びp-キシレン)、ハロゲン化炭化水素(例えばジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素及びクロロベンゼン)、エーテル(例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル(TBME)、ジオキサン、アニソール及びテトラヒドロフラン(THF))、エステル(例えば酢酸エチル及び酢酸ブチル)、ニトリル(例えばアセトニトリル及びプロピオニトリル)、ケトン(例えば、アセトン、メチルエチルケトン、ジエチルケトン、tert-ブチルメチルケトン、シクロヘキサン)、アルコール(例えば、メタノール、エタノール、n-ブロパノール、イソブロパノール、n-ブタノール及びtert-ブタノール)、有機酸(ギ酸、酢酸、プロピオン酸、シウ酸、メチルベンゼンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、カンファースルホン酸、クエン酸、トリフルオロ酢酸のような)、並びに双極性非プロトン性溶媒(例えばスルホラン、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド(DMF)、N,N-ジメチルアセトアミド(DMAC)、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン(DMI)、N,N'-ジメチルプロピレン尿素(DMPU)、ジメチルスルホキシド(DMSO)及び1-メチル-2-ピロリジノン(NMP))である。

【 0 2 2 6 】

好ましい溶媒は、上記の有機酸である。

【 0 2 2 7 】

言及した溶媒の混合物を使用することも可能である。

【 0 2 2 8 】

酸として、塩酸、臭化水素酸又は硫酸のような無機酸、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、シユウ酸、メチルベンゼンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、カンファースルホン酸、クエン酸、トリフルオロ酢酸のような有機酸を使用することができる。

【 0 2 2 9 】

酸は、一般的には、等モル量、過剰で用いられ、又は適切であれば、溶媒として使用さ

れるが、これらは触媒量で用いることもできる。

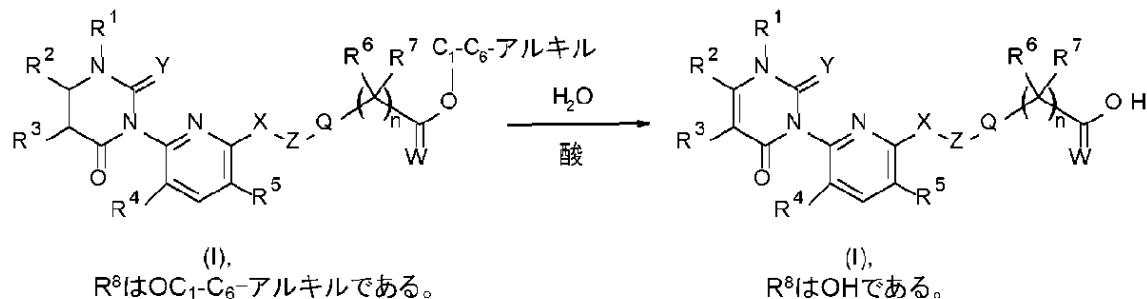
【0230】

プロセスH)

代替として、R⁸がOR⁹であり、R⁹がHである、式(I)のウラシルピリジンは、R⁸がOR⁹であり、R⁹がC₁-C₆-アルキルである、式(I)の各ウラシルピリジンから調製することができる。

【0231】

【化27】



【0232】

原理上好適なのは、R⁸がOR⁹であり、R⁹がC₁-C₆-アルキルである、式(I)のウラシルピリジンを、反応条件下で少なくとも部分的に、好ましくは完全に溶解することができる全ての溶媒である。

【0233】

好適な溶媒の例は、H₂O、脂肪族炭化水素(例えばペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン、ニトロメタン及びC₅-C₈-アルカンの混合物)、芳香族炭化水素(例えばベンゼン、クロロベンゼン、トレン、クレゾール、o-、m-及びp-キシレン)、ハロゲン化炭化水素(例えばジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素及びクロロベンゼン)、エーテル(例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル(TBME)、ジオキサン、アニソール及びテトラヒドロフラン(THF))、エステル(例えば酢酸エチル及び酢酸ブチル)、ニトリル(例えばアセトニトリル及びプロピオニトリル)、ケトン(例えば、アセトン、メチルエチルケトン、ジエチルケトン、tert-ブチルメチルケトン、シクロヘキサン)、アルコール(例えば、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロパノール、n-ブタノール及びtert-ブタノール)、有機酸(ギ酸、酢酸、プロピオン酸、シュウ酸、メチルベンゼンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、カンファースルホン酸、クエン酸、トリフルオロ酢酸のような)、並びに双極性非プロトン性溶媒(例えばスルホラン、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド(DMF)、N,N-ジメチルアセトアミド(DMAC)、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン(DMI)、N,N'-ジメチルプロピレン尿素(DMPU)、ジメチルスルホキシド(DMSO)及び1-メチル-2-ピロリジノン(NMP))である。

【0234】

好ましい溶媒は、上記に定義される、H₂O、エーテル、ニトリル、ケトン及び双極性非プロトン性溶媒である。

【0235】

より好ましい溶媒は、上記に定義される、H₂O及びエーテルである。

【0236】

言及した溶媒の混合物を使用することも可能である。

【0237】

酸及び酸触媒として、塩酸、臭化水素酸及び硫酸のような無機酸、及びギ酸、酢酸、プロピオン酸、シュウ酸、メチルベンゼンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、カンファースルホン酸、クエン酸、トリフルオロ酢酸のような有機酸を使用することができる。

【0238】

酸は、一般的に触媒量で用いられるが、これらは、等モル量で、過剰で用いることもで

10

20

30

40

50

きるし、又は適切であれば、溶媒として使用することもできる。

【0239】

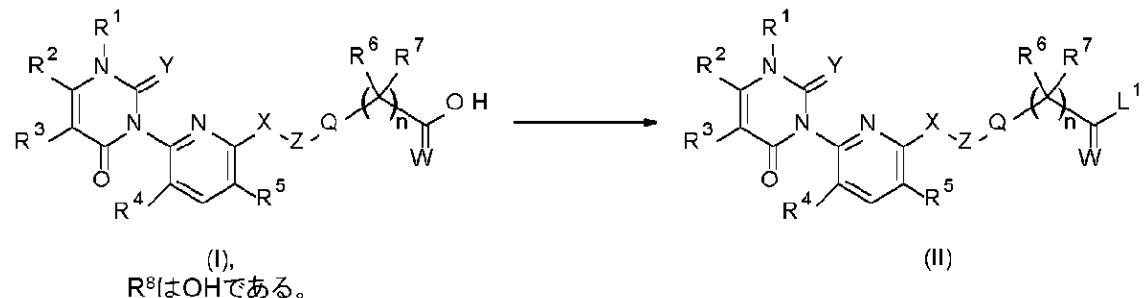
本発明による、及び上のプロセスA～Hにおいて言及した、式(I)のウラシルピリジンの調製に必要な中間体は、市販されているか、又は例えれば、以下のプロセスにより、有機化学の標準的プロセスにより調製することができる。

【0240】

式(II)の酸ハロゲン化物(上記のプロセスAに必要)は、R⁸がOR⁹であり、R⁹がHである、式(I)のウラシルピリジンから調製することができる。

【0241】

【化28】



【0242】

代替として、R⁸がOR⁹であり、R⁹がHである、式(I)のウラシルピリジンの各アルカリ金属塩を使用することができる。

【0243】

好適なハロゲン化剤は、例えれば、POCl₃、POBr₃、PCl₃、PBr₃、PCl₅、PBr₅、SOCl₂、SOBr₂、塩化オキサリル、ホスゲン、ジホスゲン、トリホスゲン、塩化シアヌル、フッ化シアヌル及び三フッ化ジエチルアミノ硫黄(DAST)である。

【0244】

本発明の好ましい実施形態によれば、塩素化剤は、ハロゲン化剤として使用される。好ましくは、POCl₃、SOCl₂、塩化オキサリル、ホスゲン、ジホスゲン、トリホスゲンが塩素化剤として使用される。

【0245】

例えれば、酸塩化物は、R⁸がOR⁹であり、R⁹がHである、式(I)のウラシルピリジンの塩素化により調製することができる。

【0246】

好適な塩素化剤は、例えれば、塩化チオニル、塩化オキサリル、三塩化リン、五塩化リン、オキシ塩化リン、ホスゲン、ジホスゲン又はトリホスゲンである。

【0247】

このような塩素化反応を行うためのさらなる情報は、以下の参考文献:A. J. Meyers及びM. E. Flanagan、*Org. Synth.* 71巻、107頁(1992年);H. J. Scheifele Jr.及びD. F. DeTar、*Org. Synth. Coll.* IV巻、34頁(1963年);G. H. Colemanら、*Org. Synth. Coll.* III巻、712頁(1955年);H. Henecka in *Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie [Methods in Organic Chemistry]*、VIII巻、第4版、Stuttgart 1952年、463頁以降に開示されている。

【0248】

式(IV)の(チオ)カルバメート(上記のプロセスBに必要)は、公知の方法(すなわち、*Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie [Methods of organic chemistry]*、E5、1985年、972～980頁、並びにまたVIII巻、655頁及びXI巻2部、10頁)と同様に、式(XI)のアミン(上記のプロセスGに必要である)と式(XIII)の化合物との反応により調製することができる:

【0249】

10

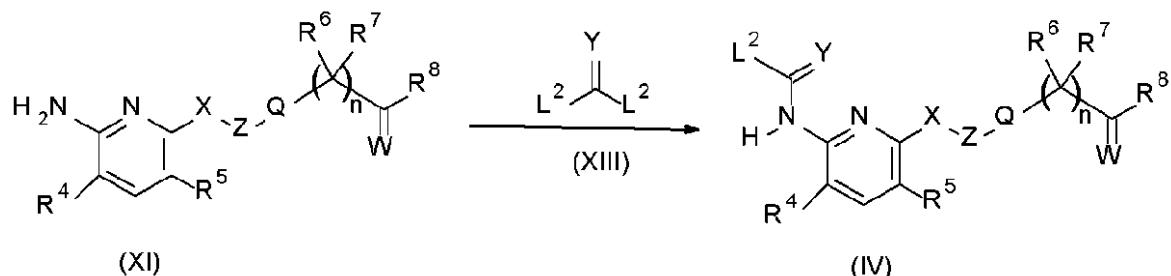
20

30

40

50

【化 2 9】



10

(0 2 5 0)

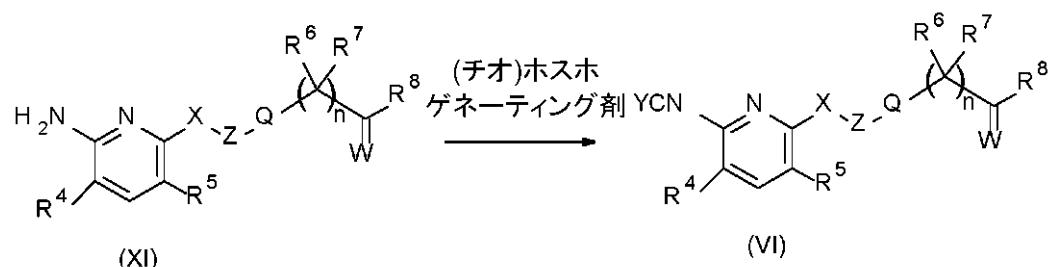
式(V)のエナミン(上記のプロセスBに必要)は、文献に開示されており(例えば、A. Lutz, A. 及び S. Trotto, *J. of Heterocyclic Chem.* 1972年、9巻、3号、513-522頁)、これに従って、調製することができる。

〔 0 2 5 1 〕

式(VI)(上記のプロセスCに必要)のイソ(チオ)シアネットは、式(XI)の対応するアミンから得ることができる：

(0 2 5 2)

【化 3 0 】



20

【 0 2 5 3 】

式(XI)のアミンの反応は、通常、-20 ℃から反応混合物の沸点まで、好ましくは10 ~ 200 ℃、特に好ましくは20 ~ 150 ℃で、不活性有機溶媒中、及び適切であれば、塩基の存在下で行われる(例えば、WO 04/39768)。

30

[0 2 5 4]

好適な(チオ)ホスホゲネーティング剤((thio)phosgenating agent)は、ホスゲン、ジホスゲン又はトリホスゲン、及び各チオ誘導体のそれぞれであり、ジホスゲンが好ましい。

(0 2 5 5)

好適な溶媒は、脂肪族炭化水素(例えば、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン、及びC5-Ca-アルカンの混合物)、芳香族炭化水素(例えば、トルエン、o-、m-及びp-キシレン)、ハロゲン化炭化水素(例えば、ジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、クロロホルム及びクロロベンゼン)、エーテル(例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、ジオキサン、アニソール及びテトラヒドロフラン)、グリコールエーテル(例えば、ジメチルグリコールエーテル、ジエチルグリコールエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル)、エステル(例えば、酢酸エチル、酢酸プロピル、イソ酪酸メチル、酢酸イソブチル)、カルボキサミド(例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、N,N-ジメチルアセトアミド)、ニトリル(例えば、アセトニトリル及びプロピオニトリル)、ケトン(例えば、アセトン、メチルエチルケトン、ジエチルケトン及びtert-ブチルメチルケトン)、並びにジメチルスルホキシドである。

40

【 0 2 5 6 】

好みいのは、トルエン、o-、m-及びp-キシレンなどの芳香族炭化水素である。

【 0 2 5 7 】

50

言及した溶媒の混合物を使用することも可能である。

【0258】

好適な塩基は、一般的に、無機化合物、例えばアルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩(例えば、炭酸リチウム、炭酸カリウム及び炭酸カルシウム)、並びにアルカリ金属の重炭酸塩(例えば、炭酸水素ナトリウム)、及びさらに有機塩基、例えば、三級アミン(例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン及びN-メチルピペリジン)、ピリジン、置換ピリジン(例えば、コリジン、ルチジン、N-メチルモルホリン及び4-ジメチルアミノピリジン)、及びまた二環式アミンである。

【0259】

特に好ましいのは、トリエチルアミンなどの三級アミンである。

10

【0260】

塩基は、一般的に触媒量で用いられるが、これらは、等モル量で、過剰で用いることもできるし、又は適切であれば、溶媒として使用することもできる。

【0261】

後処理は、公知方法で行うことができる。

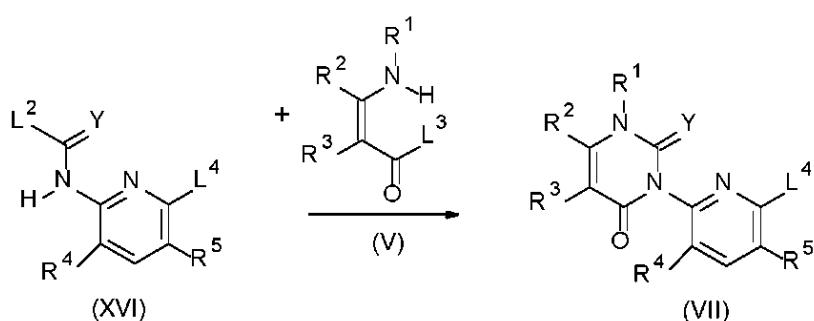
【0262】

式(VII)の化合物(上記のプロセスDに必要)は、上記のプロセスBと同様に、式(XVI)の化合物と式(V)のエナミンとの反応により調製することができる:

【0263】

【化31】

20



【0264】

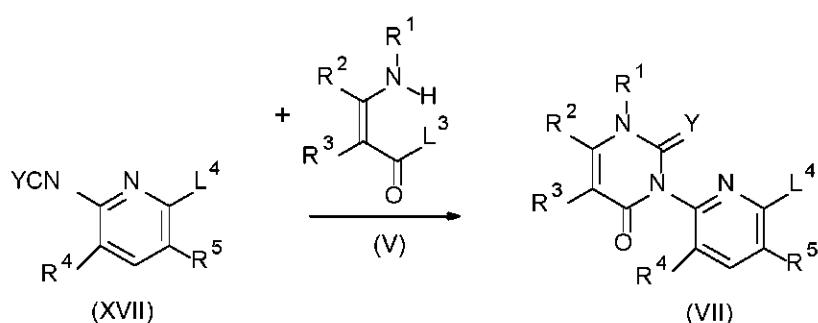
30

代替として、式(VII)の化合物(上記のプロセスDに必要)は、上記のプロセスCと同様に、式(XVII)の化合物と式(V)のエナミンとの反応により調製することができる:

【0265】

【化32】

40



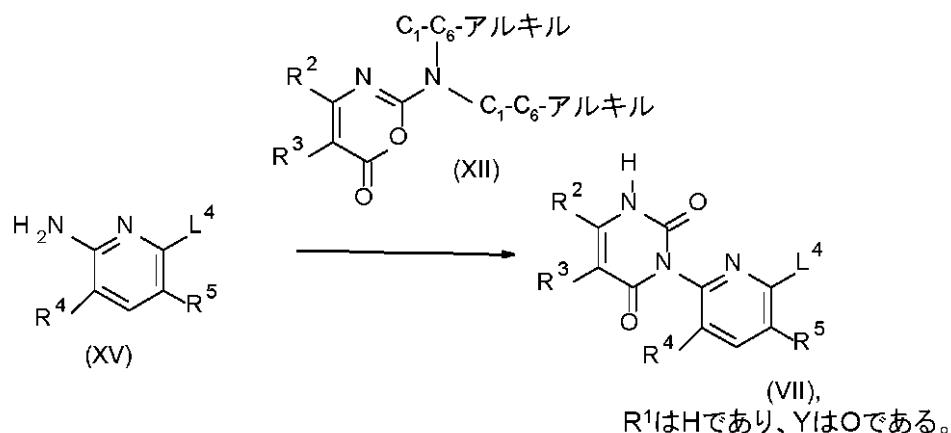
【0266】

代替として、R¹がHであり、YがOである、式(VII)の化合物は、上記のプロセスGと同様に、式(XV)の化合物と式(XII)のオキサジノンとの反応により調製することができる:

【0267】

50

【化33】



【0268】

R¹がNH₂、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-アルキニルである、式(VII)の化合物は、R¹がHである、式(VII)の化合物のアミノ化又はアルキル化により調製することができる。そのようなアミノ化又はアルキル化は、公知の方法(例えば、WO 05/054208、WO 06/125746)と同様に行うことができる。

【0269】

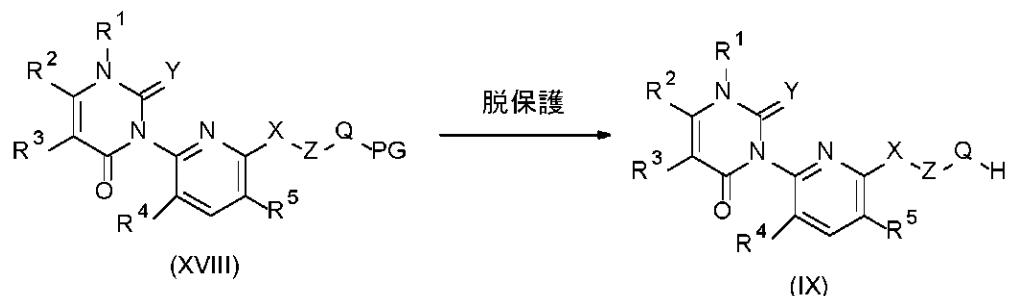
式(VIII)(上記のプロセスDに必要)の化合物は市販されているか、又は公知の方法(例えば、WO 02/098227又はWO 07/083090)によって調製することができる。

【0270】

式(IX)の化合物(上記のプロセスEに必要)は、式(XVIII)の個々の化合物の脱保護によって調製することができる:

【0271】

【化34】



【0272】

式(XVIII)の化合物内において、「PG」は、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキオキシ-C₁-C₄-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキル、C₅-C₆-シクロアルケニル、テトラヒドロピラニル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル、ホルミル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル、C₁-C₆-アルキル-O-カルボニル、C₂-C₆-アルケニル-O-カルボニル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル-C₁-C₄-アルキル、フェニル-C₁-C₄-アルキル、フェニルチオ-C₁-C₆-アルキル、フェニルカルボニルからなる群から選択される保護基であり、

フェニル環はそれぞれ、ハロゲン、CN、NO₂、C₁-C₄-アルキル及びC₁-C₄-アルコキシからなる群から選択される1~3個の置換基により置換されていてもよい。

【0273】

10

20

30

40

50

好ましくは、PGは、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、テトラヒドロピラニル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル又はフェニル-C₁-C₄-アルキルである。

【 0 2 7 4 】

例えば、式(IX)の化合物は、ジクロロメタン、アセトニトリル又は1,4-ジオキサンなどの溶媒中、又は溶媒なしに、0 ~ 150 の範囲の温度で、「PG」がメチルである式(XVI II)の化合物を三臭化ホウ素により処理することにより調製することができる。

【 0 2 7 5 】

あるいは、式(IX)の化合物は、「PG」がベンジル基である式(XVIII)の化合物を、金属と担体とが5～20%の重量比の活性炭などの不活性担体に担持されているパラジウムなどの金属触媒の存在下で、周囲温度でエタノールなどの溶媒中に懸濁した、70～700kPa、好ましくは、270～350kPaの圧力の水素ガス雰囲気中、接触水素化による脱保護によって調製することができる。

【 0 2 7 6 】

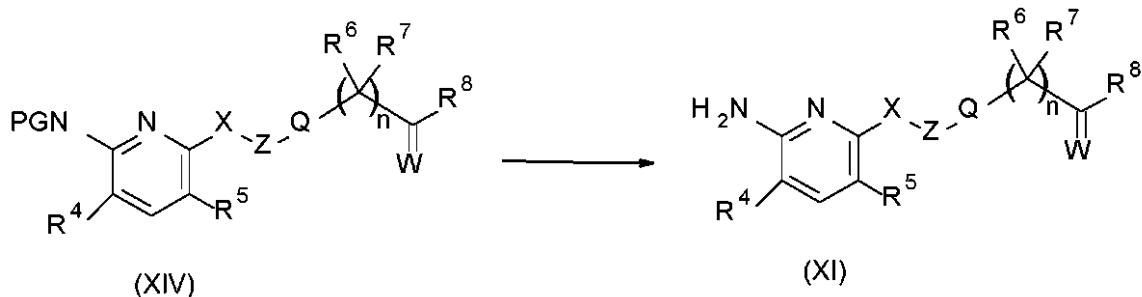
保護基の使用及び選択は、化学合成の当業者に明白となろう(例えば、Greene, T. W., Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*、第4版; Wiley: New York, 2007年を参照されたい)。

【 0 2 7 7 】

式(XI)のアミン(プロセスG、及びまた上記の式(IV)の(チオ)カルバメートの調製に必要)は、式(XIV)の対応するピリジンから得ることができる：

【 0 2 7 8 】

【化 3 5】



【 0 2 7 9 】

式(XIV)のピリジン内において、基「PGN」は、N₃、脂肪族又は芳香族カルバメート、脂肪族又は芳香族アミド、N-C₁-C₆-アルキル-アミン、N-アリール-アミン又はヘテロアリールアミドからなる群から選択される、保護アミン置換基である。

【 0 2 8 0 】

好ましくは、PGNは、N₃、C₁-C₆-アルキル-O(CO)NH-、C₁-C₆-ハロアルキル-O(CO)-NH-、(トリ-C₁-C₆-アルキル)-Si-C₁-C₆-アルキル-O(CO)NH-、C₂-C₆-アルケニル-O(CO)NH-、C₃-C₆-アルキニル-O(CO)NH-、C₃-C₆-シクロアルキル-O(CO)NH-、フルオレニルメチル-O(CO)NH-、H(CO)N-、C₁-C₆-アルキル-(CO)-NH-、C₁-C₆-ハロアルキル-(CO)-NH-、C₁-C₆-アルキル-NH、ジ(C₁-C₆-アルキル)-N-、(C₁-C₆-アルキオキシ-C₁-C₄-アルキル)NH-、ジ(C₁-C₆-アルキオキシ-C₁-C₄-アルキル)N-、C₂-C₆-アルケニル-NH、ジ(C₂-C₆-アルケニル)N-、(トリ-C₁-C₄-アルキル)-Si-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル-NH-、ジ[(トリ-C₁-C₄-アルキル)-Si-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル]N-、フルオレニルメチル-NH-、ジ(フルオレニルメチル)N-、N-フタルイミド、N-2,3-ジメチルマレイミド又はN-2,5-ジメチルピロール、フェニル-O(CO)NH-、フェニル-C₁-C₄-アルキル-O(CO)NH-、フェニル-(CO)NH-、フェニル-C₁-C₆-アルキル-(CO)NH-、ピリジル-(CO)-NH-、オルト-(C₁-C₄-アルコキシ)-フェニル-NH、ジ[オルト-(C₁-C₄-アルコキシ)-フェニル]N-、パラ-(C₁-C₄-アルコキシ)-フェニル-NH、ジ[パラ-(C₁-C₄-アルコキシ)-フェニル]N-、フ

エニル- C_1 - C_4 -アルキル-NH-、ジ(フェニル- C_1 - C_4 -アルキル)N-、パラ-(C_1 - C_4 -アルコキシ)-フェニル- C_1 - C_4 -アルキル-NH、ジ[パラ-(C_1 - C_4 -アルコキシ)-フェニル- C_1 - C_4 -アルキル]N-(フェニル環又はピリジル環はそれぞれ、ハロゲン、CN、NO₂、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ、 C_1 - C_4 -アルキルスルフィニル及び C_1 - C_4 -アルキルスルホニルからなる群から選択される1~3個の置換基により置換されていてもよい)からなる群から選択され;

より好ましくは、PGNは、 C_1 - C_6 -アルキル-O(CO)NH-、フルオレニルメチル-O(CO)NH-、H(CO)N-、 C_1 - C_6 -アルキル-(CO)-NH-、 C_1 - C_6 -ハロアルキル-(CO)-NH、N-フタルイミド、フェニル-O(CO)NH-、フェニル- C_1 - C_4 -アルキル-O(CO)NH-、フェニル- C_1 - C_4 -アルキル-NH-、ジ(フェニル- C_1 - C_4 -アルキル)N-(フェニル環又はピリジル環はそれぞれ、1~3個の C_1 - C_4 -アルコキシ置換基により置換されていてもよい)からなる群から選択される。

【0281】

「PGN」がアジド置換基である場合、式(XIV)のピリジンは、塩化アンモニウム水溶液中の亜鉛などの、還元反応条件を使用して、式(XI)のアミンに変換することができる。

【0282】

「PGN」がアシリル化アミン置換基である場合、式(XIV)のピリジンは、酸を使用して、式(XI)のアミンに変換することができる。

【0283】

「PGN」置換基の使用及び選択、並びに適切な脱保護方法は、化学合成の当業者に明白となろう(例えば、Greene, T. W.、Wuts, P. G. M. Protective Groups in Organic Synthesis、第4版; Wiley: New York、2007年を参照されたい)。

【0284】

式(XII)のオキサジノン(上記のプロセスGに必要)は、市販されているか、又は公知の方法(WO 2000/049002)によって調製することができる。

【0285】

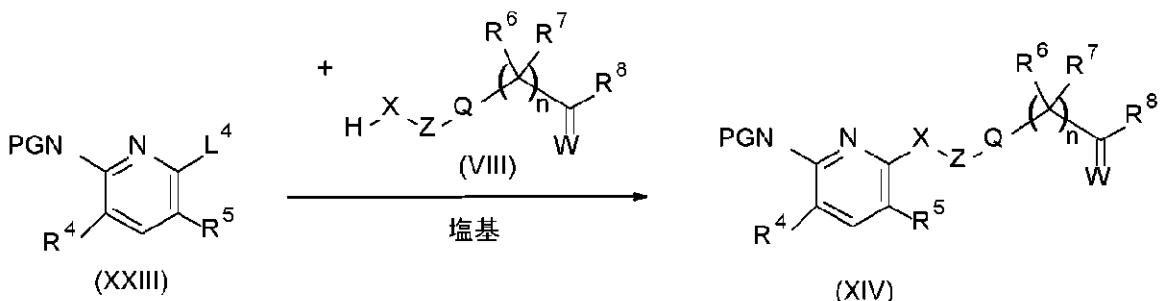
式(IV)の(チオ)カルバメートの調製に必要とされる式(XIII)の化合物は、文献(例えば、Houben-Weyl、Methoden der organischen Chemie、E4、1983年、6~17頁)に開示されており、これに従って調製することができるか、又は商業的に購入することができる。

【0286】

式(XIV)のピリジン(上記の式(IX)のアミンの調製に必要)は、式(XXIII)の化合物を、上記のプロセスDと同様に、式(VIII)の化合物(上記のプロセスDに必要)と塩基の存在下で反応させることにより調製することができる。

【0287】

【化36】



【0288】

式(XXIII)の化合物内において、L⁴は、ハロゲン、 C_1 - C_6 -アルキルスルホネート又はアリールスルホネート、好ましくは、F、Cl、 C_1 - C_6 -アルキルスルホネート又はアリールスルホネート、とりわけ好ましくは、F、Cl、メシレート又はトシレート、より好ましくはF又はClなどの脱離基である。

10

20

30

40

50

【0289】

式(XIV)及び(XXIII)の化合物内では、基「PGN」は、式(XI)のアミンについて、上記に定義される保護アミン置換基である。

【0290】

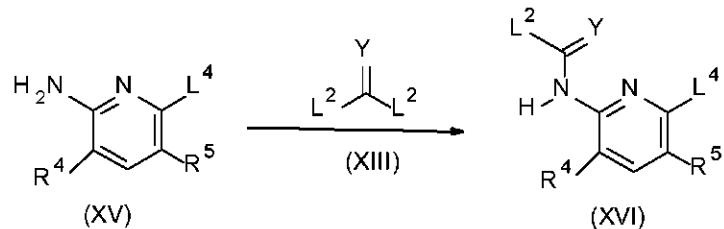
式(XVI)のピリジン、式(XVII)の化合物及び式(XXIII)の化合物の調製に必要とされる式(XV)の化合物は、市販されている。

【0291】

式(VII)の化合物の調製に必要とされる式(XVI)の化合物は、公知の方法(すなわち、Houben-Weyl、Methoden der organischen Chemie [Methods of organic chemistry]、E5、1985年、972~980頁、並びにまたVIII巻、655頁及びXI巻2部、10頁)と同様に、式(XV)の化合物と式(XIII)の化合物との反応により調製することができる。 10

【0292】

【化37】



10

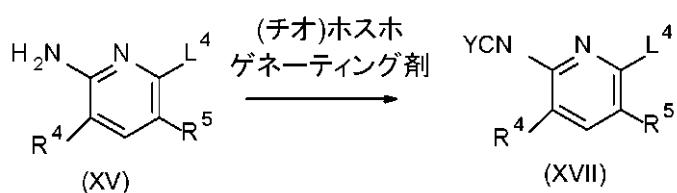
20

【0293】

式(VII)の化合物の代替的な調製に必要とされる式(XVII)の化合物は、上記の対応する式(XI)のアミンから式(VI)のイソ(チオ)シアネートの調製と同様に、式(XV)の化合物から調製することができる。 30

【0294】

【化38】



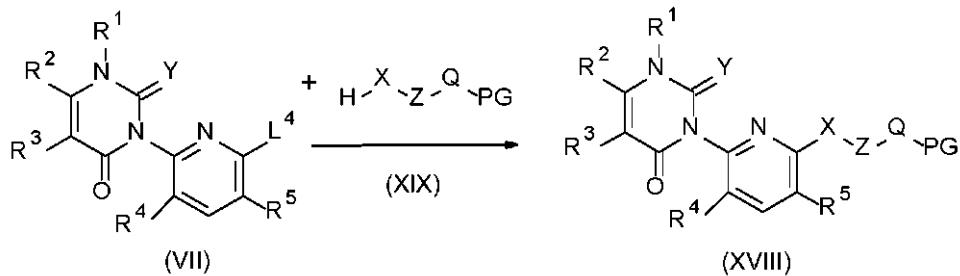
30

【0295】

式(IX)の化合物の調製に必要とされる式(XVIII)の化合物は、上記のプロセスDと同様に、塩基の存在下で、式(VII)の化合物と式(XIX)の化合物との反応により調製することができる。 40

【0296】

【化39】



40

【0297】

式(VII)の化合物内において、L⁴は、ハロゲン、C₁-C₆-アルキルスルホネート又はアリ

50

ールスルホネート、好ましくは、F、Cl、C₁-C₆-アルキルスルホネート又はアリールスルホネート、とりわけ好ましくは、F、Cl、メシレート又はトシレート、より好ましくはF又はClなどの脱離基である。

【0298】

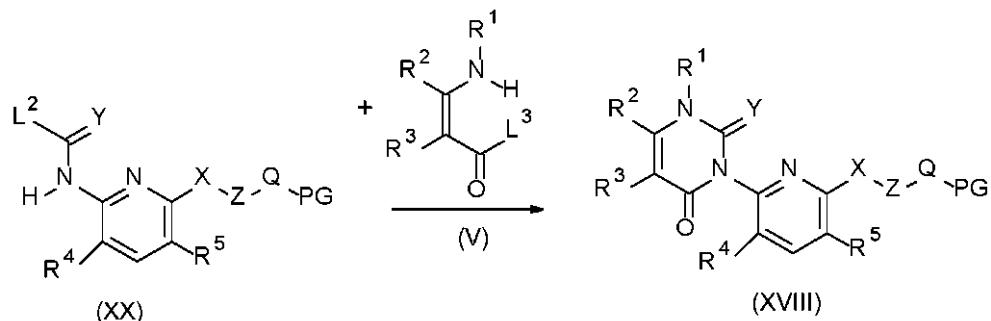
式(XIX)及び(XVIII)の化合物内では、基「PG」は、式(IX)の化合物について上記に定義される保護基である。

【0299】

代替として、式(IX)の化合物の調製に必要とされる式(XVIII)の化合物はまた、上記のプロセスBと同様に、式(XX)の(チオ)カルバメートと式(V)のエナミンとの反応により調製することができる。

【0300】

【化40】



【0301】

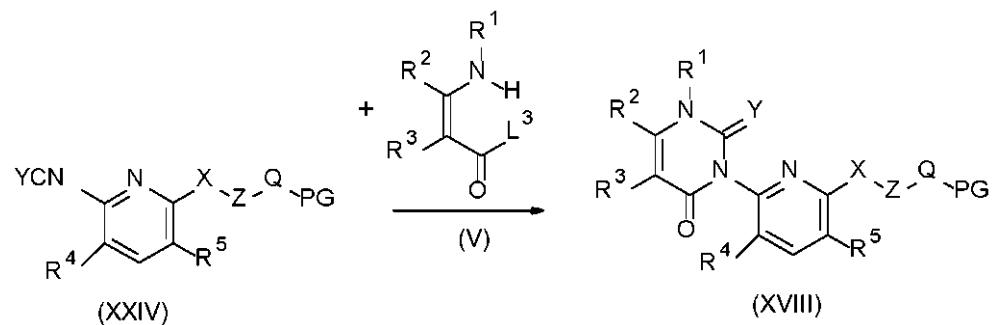
式(XX)の(チオ)カルバメート内では、「PG」は、式(IX)の化合物について上記に定義される保護基である。

【0302】

代替として、式(IX)の化合物の調製に必要とされる式(XVIII)の化合物はまた、上記のプロセスCと同様に、式(XXIV)のイソ(チオ)シアネートと式(V)のエナミンとの反応により調製することができる:

【0303】

【化41】



【0304】

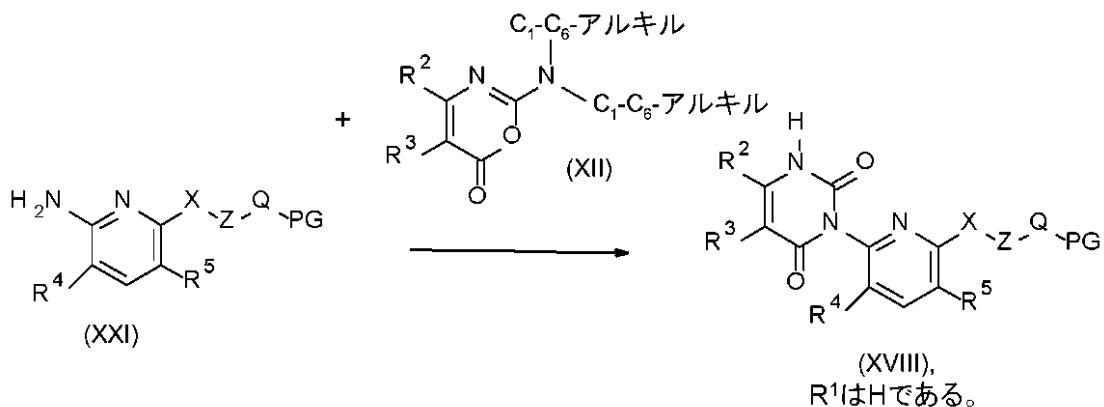
式(XXIV)及び(XVIII)の化合物内では、基「PG」は、式(IX)の化合物について上記に定義される保護基である。

【0305】

代替として、R¹がHであり、YがOである、式(XVIII)の化合物は、上記のプロセスGと同様に、式(XXI)のアミンと式(XII)のオキサジノンとの反応により調製することができる:

【0306】

【化42】



【0307】

R¹がNH₂、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-アルキニルである、式(XVIII)の化合物は、R¹がHである、式(XVIII)の化合物のアミノ化又はアルキル化により調製することができる。このようなアミノ化又はアルキル化は、公知の方法(例えば、WO 05/054208、WO 06/125746)と同様に行うことができる。

【0308】

式(XVIII)の化合物の調製に必要とされる式(XIX)の化合物は、市販されている。

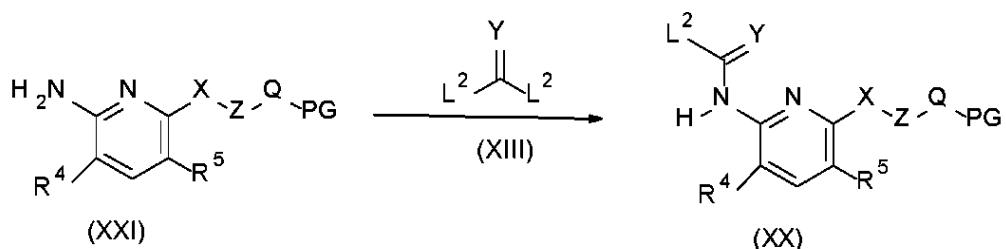
20

【0309】

式(XVIII)の化合物の調製に必要とされる式(XX)の(チオ)カルバメートは、公知の方法(すなわち、Houben-Weyl、Methoden der organischen Chemie [Methods of organic chemistry]、E5、1985年、972~980年、並びにまたVIII巻、655頁及びXI巻2部、10頁)と同様に、式(XXI)のアミンと式(XIII)の化合物との反応により調製することができる:

【0310】

【化43】



【0311】

式(XX)の(チオ)カルバメート及び式(XXI)のアミン内では、基「PG」は、式(IX)の化合物について上記に定義される保護基である。

【0312】

式(XX)の(チオ)カルバメートの調製に必要とされる式(XXI)のアミンは、対応する式(XIII)のピリジンから調製することができる:

40

【0313】

【化44】



50

【0314】

式(XXII)のピリジン内では、基「PG」は、式(IX)の化合物について上記に定義される保護基である。

【0315】

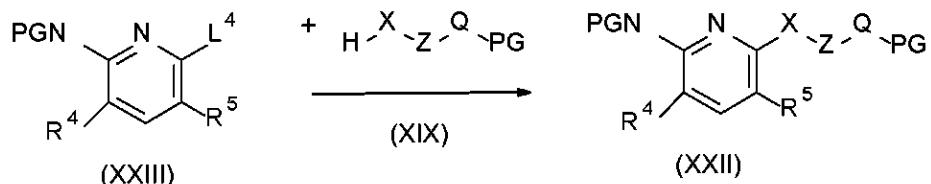
式(XXII)のピリジン内では、基「PGN」は、式(XI)のアミンについて上記に定義される保護アミン置換基である。

【0316】

式(XXI)のアミンの調製に必要とされる式(XXII)のピリジンは、上記のプロセスDと同様に、塩基の存在下で、式(XXIII)の化合物と式(XIX)の化合物とから調製することができる:

【0317】

【化45】



【0318】

式(XXIII)の化合物内において、L⁴は、ハロゲン、C₁-C₆-アルキルスルホネート又はアリールスルホネート、好ましくは、F、Cl、C₁-C₆-アルキルスルホネート又はアリールスルホネート、とりわけ好ましくは、F、Cl、メシレート又はトシレート、より好ましくはF又はClなどの脱離基である。

【0319】

式(XXII)のピリジン及び式(XIX)の化合物内では、基「PG」は、式(IX)の化合物について上記に定義される保護基である。

【0320】

式(XXII)のピリジン及び式(XXIII)の化合物内では、基「PGN」は、式(XI)のアミンについて上記に定義される保護アミン置換基である。

【0321】

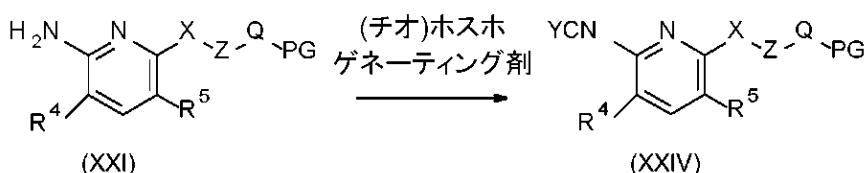
式(XXII)のピリジンの調製に必要とされる式(XXIII)の化合物は、市販されているか、又は対応するアミンXVから公知の方法(例えば、Greene, T. W., Wuts, P. G. M. Protective Groups in Organic Synthesis、第4版; Wiley: New York、2007年)により調製することができる。

【0322】

式(XVIII)の化合物の代替的な調製に必要とされる式(XXIV)のイソ(チオ)シアネートは、上記の対応する式(XI)のアミンから式(VI)のイソ(チオ)シアネートの調製と同様に、式(XXI)のアミンから得ることができる:

【0323】

【化46】



【0324】

式(II)の酸ハロゲン化物は、新規化合物であり、上で示されているとおり、本発明による式(I)のウラシルピリジンの調製に適した中間体である。

【0325】

従って、本発明はまた、式(II)

10

20

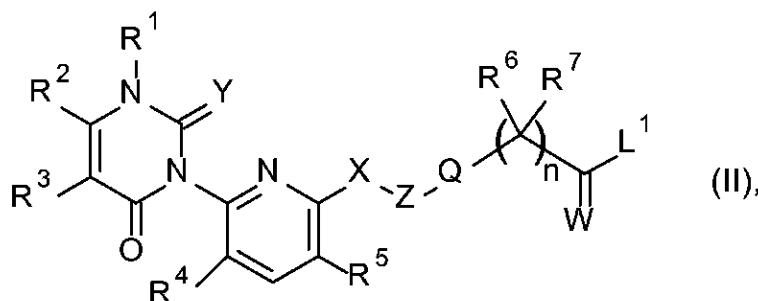
30

40

50

【0326】

【化47】



[式中、置換基は以下の意味を有する:

R¹は、水素、NH₂、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-アルキニルであり;R²は、水素、C₁-C₆-アルキル又はC₁-C₆-ハロアルキルであり;R³は、水素又はC₁-C₆-アルキルであり;R⁴は、H又はハロゲンであり;R⁵は、ハロゲン、CN、NO₂、NH₂、CF₃又はC(=S)NH₂であり;R⁶は、H、ハロゲン、CN、C₁-C₃-アルキル、C₁-C₃-ハロアルキル、C₁-C₃-アルコキシ、C₁-C₃-ハロアルコキシ、C₁-C₃-アルキルチオ、(C₁-C₃-アルキル)アミノ、ジ(C₁-C₃-アルキル)アミノ、C₁-C₃-アルコキシ-C₁-C₃-アルキル、C₁-C₃-アルコキシカルボニルであり;R⁷は、H、ハロゲン、C₁-C₃-アルキル、C₁-C₃-アルコキシであり;

nは、1~3であり;

Qは、O、S、SO、SO₂、NH又は(C₁-C₃-アルキル)Nであり;

Wは、O又はSであり;

Xは、O又はSであり;

Yは、O又はSであり;

Zは、それぞれ、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシからなる群から選択される、1~4個の置換基により場合により置換されている、フェニル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル又はピラジニルであり;L¹は、ハロゲンである]

の酸ハロゲン化物を提供する。

【0327】

好ましくは、

L¹が、F、Cl又はBrであり;

とりわけ好ましくは、F又はClであり;

より好ましくは、Clである、

式(II)の酸ハロゲン化物である。

【0328】

可変要素に関すると、式(II)の酸ハロゲン化物の特に好ましい実施形態は、互いに独立して、若しくは互いに組み合わせて、式(I)のウラシルピリジンのR¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、n、Q、W、X、Y、Zの可変要素のものと対応するか、又は互いに独立して、若しくは互いに組み合わせて、以下の意味を有する:R¹は、NH₂又はCH₃であり;R²は、C₁-C₄-ハロアルキルであり;R³は、Hであり;R⁴は、H、F又はClであり;R⁵は、F、Cl、Br又はCNであり;

20

30

40

50

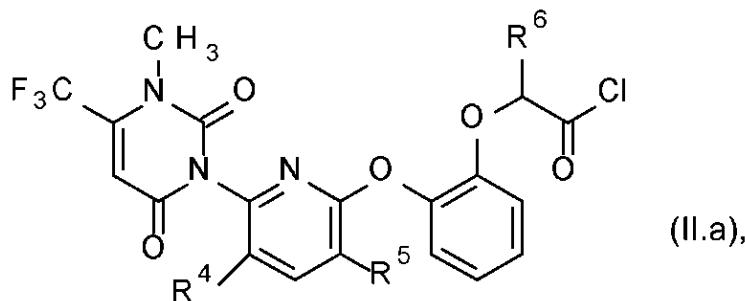
R^6 は、H、C₁-C₃-アルキル又はC₁-C₃-アルコキシであり；
 R^7 は、Hであり；
 n は、1であり；
 Q は、O又はSであり；
 W は、Oであり；
 X は、Oであり；
 Y は、Oであり；
 Z は、上記に定義される、 Z^1 、 Z^4 、 Z^5 、 Z^6 及び Z^7 からなる群から選択され、 R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 及び R^e は、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシであり；
 L^1 は、CIであり；
 好ましくは、
 R^1 は、NH₂又はCH₃であり；
 R^2 は、C₁-C₄-ハロアルキルであり；
 R^3 は、Hであり；
 R^4 は、H、F又はCIであり；
 R^5 は、F、CI又はCNであり；
 R^6 は、H、C₁-C₃-アルキル又はC₁-C₃-アルコキシであり；
 R^7 は、Hであり；
 n は、1であり；
 Q は、O又はSであり；
 W は、Oであり；
 X は、Oであり；
 Y は、Oであり；
 Z は、上記に定義される、 Z^1 、 Z^4 、 Z^5 、 Z^6 及び Z^7 からなる群から選択され、 R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 及び R^e は、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシであり；
 L^1 は、CIである。

【0329】

特に好ましいのは、式(II.a)(R^1 がCH₃であり、 R^2 がCF₃であり、 R^3 がHであり、 R^7 がHであり、 n が1であり、 Q 、 W 、 X 及び Y がOであり、 Z が定義されるZ-1であり、 R^a 、 R^b 、 R^c 及び R^d がHであり、 L^1 がCIである、式(II)に相当する)：

【0330】

【化48】



(式中、可変要素 R^4 、 R^5 、 R^6 及び L^1 は、上記に定義される意味、特に好ましい意味を有する)

の酸ハロゲン化物である。

【0331】

特に好ましいのは、表I-1の式(II.a.1)～(II.a.24)の酸ハロゲン化物、好ましくは式(II.a.1)～(II.a.18)の酸ハロゲン化物であり、可変要素 R^4 、 R^5 及び R^6 の定義は、互いに組み合わせてだけではなく、各場合においてそれ自体も、本発明による化合物にとって特に重要

10

20

30

40

50

である。

【0332】

【表2】

表 I-1

番号	R ⁴	R ⁵	R ⁶
II.a.1.	H	F	H
II.a.2.	H	F	CH ₃
II.a.3.	H	F	OCH ₃
II.a.4.	H	Cl	H
II.a.5.	H	Cl	CH ₃
II.a.6.	H	Cl	OCH ₃
II.a.7.	H	CN	H
II.a.8.	H	CN	CH ₃
II.a.9.	H	CN	OCH ₃
II.a.10.	F	F	H
II.a.11.	F	F	CH ₃
II.a.12.	F	F	OCH ₃
II.a.13.	F	Cl	H
II.a.14.	F	Cl	CH ₃
II.a.15.	F	Cl	OCH ₃
II.a.16.	F	CN	H
II.a.17.	F	CN	CH ₃
II.a.18.	F	CN	OCH ₃
II.a.19.	H	Br	H
II.a.20.	H	Br	CH ₃
II.a.21.	H	Br	OCH ₃
II.a.22.	F	Br	H
II.a.23.	F	Br	CH ₃
II.a.24.	F	Br	OCH ₃

10

20

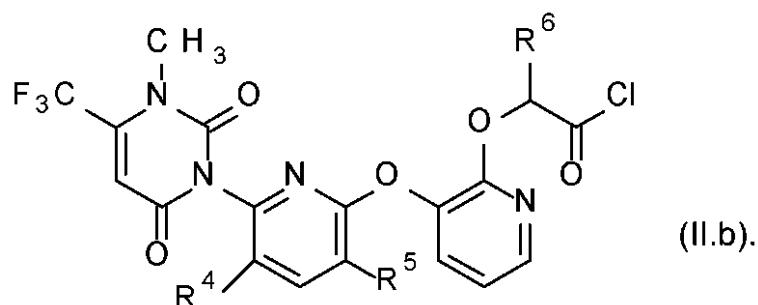
30

【0333】

同様に好ましいのは、ZがZ-7(R^a、R^b及びR^cは、Hである)という点においてのみ式(II.a.1)~(II.a.24)の対応する酸ハロゲン化物と異なる、式(II.b)の酸ハロゲン化物、好ましくは式(II.b.1)~(II.b.24)の酸ハロゲン化物、特に好ましいのは、式(II.b.1)~(II.b.18)の酸ハロゲン化物である:

【0334】

【化49】



40

【0335】

式(IX)及び(XVIII)の化合物を組み合わせた式(int-1)の中間体は、新規化合物であり、上で示されているとおり、本発明による式(I)のウラシルピリジンの調製に適した中間体で

50

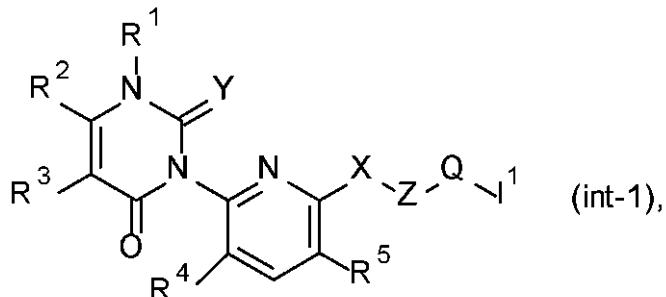
ある。

[0 3 3 6]

従って、本発明はまた、式(int-1)

〔 0 3 3 7 〕

【化 5 0 】



10

[式中、置換基は以下の意味を有する:]

R^1 は、水素、 NH_2 、 C_1-C_6 -アルキル又は C_3-C_6 -アルキニルであり；

R²は、水素、C₁-C₆-アルキル又はC₁-C₆-ハロアルキルであり；

R^3 は、水素又はC₁-C₆-アルキルであり：

\mathbb{R}^4 は、 H 又は八口ゲンであり：

20

R^5 は、ハロゲン、CN、NO₂、NH₂、CF₃又はC(=S)NH₂であり；

Qは、O、S、SO、SO₂、NH又は(C₁-C₃-アルキル)Nであり；

Xは、O又はSであり；

Yは、O又はSであり；

Zは、それぞれ、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシからなる群から選択される、1～4個の置換基により場合により置換されている、フェニル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル又はピラジニルであり、

I^1 は、H又はPGであり、PGは、

C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキオキシ-C₁-C₄-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シルクロアルキル-C₁-C₄-アルキル、C₅-C₆-シクロアルケニル、テトラヒドロピラニル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル、ホルミル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル、C₁-C₆-アルキル-O-カルボニル、C₂-C₆-アルケニル-O-カルボニル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル-C₁-C₄-アルキル、フェニル-C₁-C₄-アルキル、フェニルチオ-C₁-C₆-アルキル、フェニルカルボニル

30

からなる群から選択される保護基であり；

フェニル環はそれぞれ、ハロゲン、CN、NO₂、C₁-C₄-アルキル及びC₁-C₄-アルコキシからなる群から選択される1～3個の置換基により置換されていてもよい]の中間体(それらの農業上許容可能な塩又は誘導体を含む)

であって、但し、カルボキシル基を有することを条件とする、式(int-1)の中間体を提供する。

[0 3 3 8]

好みしくは、

I¹が、H、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、テトラヒドロピラニル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル又はフェニル-C₁-C₄-アルキルで

50

あり、
とりわけ好ましくは、Hである、
式(int-1)の中間体である。

【0339】

可変要素に関すると、式(int-1)の中間体の特に好ましい実施形態は、互いに独立して、若しくは互いに組み合わせて、式(I)のウラシルピリジンのR¹、R²、R³、R⁴、Q、X、Y及びZの可変要素のものと対応するか、又は互いに独立して、若しくは互いに組み合わせて、以下の意味を有する：

R¹は、NH₂又はCH₃であり；

R²は、C₁-C₄-ハロアルキルであり；

R³は、Hであり；

R⁴は、H、F又はClであり；

R⁵は、F、Cl、Br又はCNであり；

nは、1であり；

Qは、O又はSであり；

Xは、Oであり；

Yは、Oであり；

Zは、上記に定義される、Z¹、Z⁴、Z⁵、Z⁶及びZ⁷からなる群から選択され、R^a、R^b、R^c、R^d及びR^eは、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシであり；

I¹は、H、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、テトラヒドロピラニル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル又はフェニル-C₁-C₄-アルキルであり；

好ましくは、

R¹は、NH₂又はCH₃であり；

R²は、C₁-C₄-ハロアルキルであり；

R³は、Hであり；

R⁴は、H、F又はClであり；

R⁵は、F、Cl又はCNであり；

nは、1であり；

Qは、O又はSであり；

Xは、Oであり；

Yは、Oであり；

Zは、上記に定義される、Z¹、Z⁴、Z⁵、Z⁶及びZ⁷からなる群から選択され、R^a、R^b、R^c、R^d及びR^eは、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシであり；

I¹は、H、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、テトラヒドロピラニル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル又はフェニル-C₁-C₄-アルキルである。

【0340】

特に好ましいのは、式(int-1.a)(R¹がCH₃であり、R²がCF₃であり、R³がHであり、Q、X及びYが、Oであり、Zが、定義されるZ-1であり、R^a、R^b、R^c及びR^dが、Hである、式(int-1)に相当する)：

【0341】

10

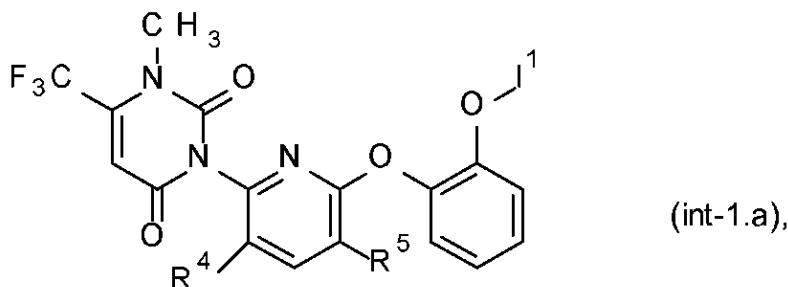
20

30

40

50

【化 5 1】



10

(式中、可変要素R⁴、R⁵及びI¹は、上記に定義される意味、特に好ましい意味を有する)の中間体である。

【0 3 4 2】

特に好ましいのは、表I-2の式(int-1.a.1)~(int-1.a.24)の中間体、好ましくは式(int-1.a.1)~(int-1.a.18)の中間体であり、可変要素R⁴、R⁵及びI¹の定義は、互いに組み合わせてだけではなく、各場合においてそれ自体も、本発明による化合物にとって特に重要である。

【0 3 4 3】

【表 3】

表 I-2

番号	R ⁴	R ⁵	I ¹
int-1.a.1.	H	F	H
int-1.a.2.	H	F	CH ₃
int-1.a.3.	H	F	CH ₂ -C ₆ H ₅
int-1.a.4.	H	Cl	H
int-1.a.5.	H	Cl	CH ₃
int-1.a.6.	H	Cl	CH ₂ -C ₆ H ₅
int-1.a.7.	H	CN	H
int-1.a.8.	H	CN	CH ₃
int-1.a.9.	H	CN	CH ₂ -C ₆ H ₅
int-1.a.10.	F	F	H
int-1.a.11.	F	F	CH ₃
int-1.a.12.	F	F	CH ₂ -C ₆ H ₅
int-1.a.13.	F	Cl	H
int-1.a.14.	F	Cl	CH ₃
int-1.a.15.	F	Cl	CH ₂ -C ₆ H ₅
int-1.a.16.	F	CN	H
int-1.a.17.	F	CN	CH ₃
int-1.a.18.	F	CN	CH ₂ -C ₆ H ₅
int-1.a.19.	H	Br	H
int-1.a.20.	H	Br	CH ₃
int-1.a.21.	H	Br	CH ₂ -C ₆ H ₅
int-1.a.22.	F	Br	H
int-1.a.23.	F	Br	CH ₃
int-1.a.24.	F	Br	CH ₂ -C ₆ H ₅

20

【0 3 4 4】

同様に好ましいのは、ZがZ-7(R^a、R^b及びR^cは、Hである)という点においてのみ式(int-1.a.1)~(int-1.a.24)の対応する中間体と異なる、式(int-1.b)の中間体、好ましくは式(i

30

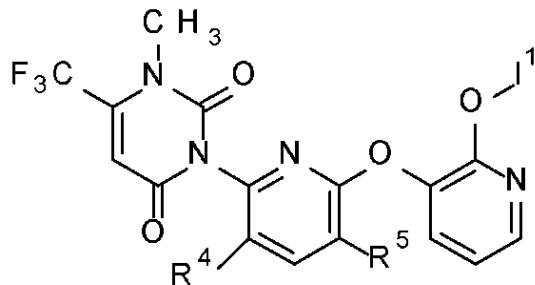
40

50

nt-1.b.1) ~ (int-1.b.24)の中間体、特に好ましいのは、式(int-1.b.1) ~ (int-1.b.18)の中間体である式:

【0345】

【化52】



(int-1.b.).

10

【0346】

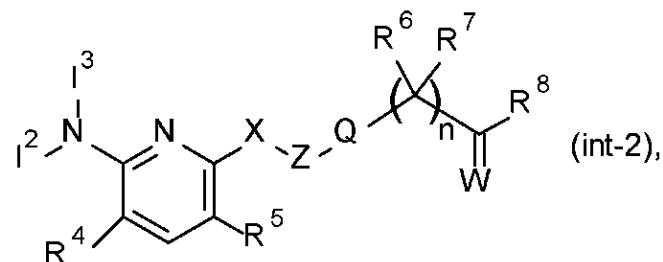
式(IV)の(チオ)カルバメート、式(VI)のイソ(チオ)シアネート、式(XI)のアミン及び式(XIV)のピリジンを組み合わせた式(int-2)の中間体は、新規化合物であり、上で示されているとおり、本発明による式(I)のウラシルピリジンの調製に適した中間体である。

【0347】

従って、本発明はまた、式(int-2)

【0348】

【化53】



(int-2),

20

【式中、置換基は以下の意味を有する:

30

R4は、H又はハロゲンであり;

R5は、ハロゲン、CN、NO2、NH2、CF3又はC(=S)NH2であり;

R6は、H、ハロゲン、CN、C1-C3-アルキル、C1-C3-ハロアルキル、C1-C3-アルコキシ、C1-C3-ハロアルコキシ、C1-C3-アルキルチオ、(C1-C3-アルキル)アミノ、ジ(C1-C3-アルキル)アミノ、C1-C3-アルコキシ-C1-C3-アルキル、C1-C3-アルコキシカルボニルであり;

R7は、H、ハロゲン、C1-C3-アルキル、C1-C3-アルコキシであり;

R8は、OR9、SR9、NR10R11、NR9OR9、NR9S(O)2R10又はNR9S(O)2NR10R11であり、

R9は、水素、C1-C6-アルキル、C3-C6-アルケニル、C3-C6-アルキニル、C1-C6-ハロアルキル、C3-C6-ハロアルケニル、C3-C6-ハロアルキニル、C1-C6-シアノアルキル、C1-C6-アルコキシ-C1-C6-アルキル、C1-C6-アルコキシ-C1-C6-アルコキシ-C1-C6-アルキル、ジ(C1-C6-アルコキシ)C1-C6-アルキル、C1-C6-ハロアルコキシ-C1-C6-アルキル、C3-C6-アルケニルオキシ-C1-C6-アルキル、C3-C6-ハロアルケニルオキシ-C1-C6-アルキル、C3-C6-アルケニルオキシ-C1-C6-アルコキシ-C1-C6-アルキル、C1-C6-アルキルチオ-C1-C6-アルキル、C1-C6-アルキルスルフィニル-C1-C6-アルキル、C1-C6-アルキルスルホニル-C1-C6-アルキル、C1-C6-アルキルカルボニル-C1-C6-アルキル、C1-C6-アルコキシカルボニル-C1-C6-アルキル、C1-C6-ハロアルコキシカルボニル-C1-C6-アルキル、C3-C6-アルケニルオキシカルボニル-C1-C6-アルキル、C3-C6-アルキニルオキシカルボニル-C1-C6-アルキル、アミノ、(C1-C6-アルキル)アミノ、ジ(C1-C6-アルキル)アミノ、(C1-C6-ア

40

50

ルキルカルボニル)アミノ、アミノ-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、

-N=CR¹²R¹³(R¹²及びR¹³は、互いに独立して、H、C₁-C₄-アルキル又はフェニルである)、

C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ヘテロシクリル、C₃-C₆-ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル、フェニル、フェニル-C₁-C₄-アルキル又は5員若しくは6員のヘテロアリールであり、

シクロアルキル環、ヘテロシクリル環、フェニル環又はヘテロアリール環はそれぞれ、R¹⁴から選択される1~4個の置換基又は3~7員の炭素環により置換されていてもよく、

この炭素環は、炭素原子に加えて、-N(R¹²)-、-N=N-、-C(=O)-、-O-及び-S-からなる群から選択される1又は2個の環員を場合により有しており、

この炭素環は、R¹⁴から選択される1~4個の置換基により場合により置換されており、

R¹⁴は、ハロゲン、NO₂、CN、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ又はC₁-C₄-アルコキカルボニルであり；

R¹⁰、R¹¹は、互いに独立して、R⁹であるか、又は一緒になって3~7員の炭素環を形成し、

この炭素環は、炭素原子に加えて、-N(R¹²)-、-N=N-、-C(=O)-、-O-及び-S-からなる群から選択される1又は2個の環員を場合により有しており、

この炭素環は、R¹⁴から選択される1~4個の置換基により場合により置換されており；

nは、1~3であり；

Qは、O、S、SO、SO₂、NH又は(C₁-C₃-アルキル)Nであり；

Wは、O又はSであり；

Xは、O又はSであり；

Zは、それぞれ、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシからなる群から選択される、1~4個の置換基により場合により置換されている、フェニル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル又はピラジニルであり；

I²は、Hであり；

I³は、H又はC(=Y)L²であり；

Yは、O又はSであり、

L²は、求核的に置換可能な脱離基、好ましくはC₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ又はアリールオキシ(アリール部分は、それ自体、部分的に若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、並びに/又はシアノ、ニトロ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-アルキルチオからなる群からの1~3個の置換基により置換されていてもよい)であるか、

又はI²とI³は、それらが結合しているN原子と一緒にになって、基「YCN」(YはO又はSである)、

又は基「PGN」(これは、N₃、脂肪族又は芳香族カルバメート、脂肪族又は芳香族アミド、N-C₁-C₆-アルキル-アミン、N-アリール-アミン又はヘテロアリールアミドからなる群から選択される、保護アミン置換基である)を形成する】

の中間体(それらの塩を含む)を提供する。

【0349】

L²は、好ましくは、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ又はフェニルオキシ、(フェニル部分は、それ自体、部分的に若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、並びに/又はシアノ、ニトロ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-アルキルチオから

10

20

30

40

50

なる群からの1~3つの基により置換されてもよい)であり;

より好ましくは、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ又はフェニルオキシであり;

最も好ましくは、C₁-C₆-アルコキシである。

【0350】

好ましくは、PGNは、N₃、C₁-C₆-アルキル-O(CO)NH-、C₁-C₆-ハロアルキル-O(CO)-NH-、(トリ-C₁-C₆-アルキル)-Si-C₁-C₆-アルキル-O(CO)NH-、C₂-C₆-アルケニル-O(CO)NH-、C₃-C₆-アルキニル-O(CO)NH-、C₃-C₆-シクロアルキル-O(CO)NH-、フルオレニルメチル-O(CO)NH-、H(CO)N-、C₁-C₆-アルキル-(CO)-NH-、C₁-C₆-ハロアルキル-(CO)-NH-、C₁-C₆-アルキル-NH、ジ(C₁-C₆-アルキル)-N-、(C₁-C₆-アルキオキシ-C₁-C₄-アルキル)NH-、ジ(C₁-C₆-アルキオキシ-C₁-C₄-アルキル)N-、C₂-C₆-アルケニル-NH、ジ(C₂-C₆-アルケニル)N-、(トリ-C₁-C₄-アルキル)-Si-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル-NH-、ジ[(トリ-C₁-C₄-アルキル)-Si-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル]N-、フルオレニルメチル-NH-、ジ(フルオレニルメチル)N-、N-フタルイミド、N-2,3-ジメチルマレイミド又はN-2,5-ジメチルピロール、フェニル-O(CO)NH-、フェニル-C₁-C₄-アルキル-O(CO)NH-、フェニル-(CO)NH-、フェニル-C₁-C₆-アルキル-(CO)NH-、ピリジル-(CO)-NH-、オルト-(C₁-C₄-アルコキシ)-フェニル-NH、ジ[オルト-(C₁-C₄-アルコキシ)-フェニル]N-、パラ-(C₁-C₄-アルコキシ)-フェニル-NH、ジ[パラ-(C₁-C₄-アルコキシ)-フェニル]N-、フェニル-C₁-C₄-アルキル-NH-、ジ(フェニル-C₁-C₄-アルキル)N-、パラ-(C₁-C₄-アルコキシ)-フェニル-C₁-C₄-アルキル-NH-、ジ[パラ-(C₁-C₄-アルコキシ)-フェニル-C₁-C₄-アルキル]N-からなる群から選択され、

フェニル環又はピリジル環はそれぞれ、ハロゲン、CN、NO₂、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-アルキルスルフィニル及びC₁-C₄-アルキルスルホニルからなる群から選択される1~3個の置換基により置換されていてもよく;

より好ましくは、PGNは、C₁-C₆-アルキル-O(CO)NH-、フルオレニルメチル-O(CO)NH-、H(CO)N-、C₁-C₆-アルキル-(CO)-NH-、C₁-C₆-ハロアルキル-(CO)-NH、N-フタルイミド、フェニル-O(CO)NH-、フェニル-C₁-C₄-アルキル-O(CO)NH-、フェニル-C₁-C₄-アルキル-NH-、ジ(フェニル-C₁-C₄-アルキル)N-からなる群から選択され、

フェニル環又はピリジル環はそれぞれ、1~3個のC₁-C₄-アルコキシ置換基により置換されていてもよい。

【0351】

式(int-2)の中間体の好適な塩は、記載されるアミド又はカルバメート誘導体の、NH₄⁺、Li⁺、Na⁺、K⁺又はMg²⁺塩を含む。

【0352】

特に好ましいのは、I²及びI³がHである、式(int-2)の中間体である。

【0353】

可変要素に関して、式(int-2)の中間体の特に好ましい実施形態は、互いに独立して、若しくは互いに組み合わせて、式(I)のウラシルピリジンのR⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴、n、Q、W、X、Y及びZの可変要素のものと対応するか、又は互いに独立して、若しくは互いに組み合わせて、以下の意味を有し:

R⁴は、H、F又はClであり;

R⁵は、F、Cl、Br又はCNであり;

R⁶は、H、C₁-C₃-アルキル又はC₁-C₃-アルコキシであり;

R⁷は、Hであり;

R⁸は、OR⁹又はNR⁹S(O)₂R¹⁰であり、

R⁹は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル又はC₁-C₆-ハロアルキルであり、

R¹⁰は、C₁-C₆-アルキルであり;

nは、1であり;

Qは、O又はSであり;

Wは、Oであり;

10

20

30

40

50

Xは、Oであり；

Yは、Oであり；

Zは、上記に定義される、Z¹、Z⁴、Z⁵、Z⁶及びZ⁷からなる群から選択され、R^a、R^b、R^c、R^d及びR^eは、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシであり；

I²は、Hであり；

I³は、H又はC(=Y)L²であり、Yは、Oであり、L²は、C₁-C₅-アルコキシであるか、又はI²とI³は、それらが結合しているN原子と一緒にになって、「YCN」から選択される基を形成し、YはOであり、

式(int-2)の中間体の塩を含み；

10

好ましくは、

R⁴は、H、F又はClであり；

R⁵は、F、Cl又はCNであり；

R⁶は、H、C₁-C₃-アルキル又はC₁-C₃-アルコキシであり；

R⁷は、Hであり；

R⁸は、OR⁹又はNR⁹S(O)₂R¹⁰であり、

R⁹は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル又はC₁-C₆-ハロアルキルであり、

R¹⁰は、C₁-C₆-アルキルであり；

nは、1であり；

20

Qは、O又はSであり；

Wは、Oであり；

Xは、Oであり；

Yは、Oであり；

Zは、上記に定義される、Z¹、Z⁴、Z⁵、Z⁶及びZ⁷からなる群から選択され、R^a、R^b、R^c、R^d及びR^eは、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシであり；

I²は、Hであり；

I³は、H又はC(=Y)L²であり、Yは、Oであり、L²は、C₁-C₅-アルコキシであるか、

又はI²とI³は、それらが結合しているN原子と一緒にになって、「YCN」から選択される基を形成し、YはOであり、

式(int-2)の中間体の塩を含む。

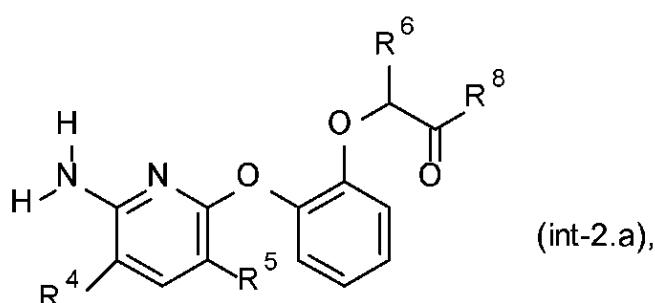
30

【0354】

好ましいのは、式(int-2.a)(R⁷がHであり、nが1であり、Q、W、X及びYが、Oであり、Zが、定義されているZ-1であり、R^a、R^b、R^c及びR^dが、Hであり、I²及びI³が、Hである、式(int-2)に相当する)：

【0355】

【化54】



(可変要素R⁴、R⁵、R⁶及びR⁸は、上記に定義される意味、特に好ましい意味を有する)の中間体であり、

特に好ましいのは、式(int-2.a.1)～(int-2.a.672)の中間体であり、好ましくは式(int-2.

50

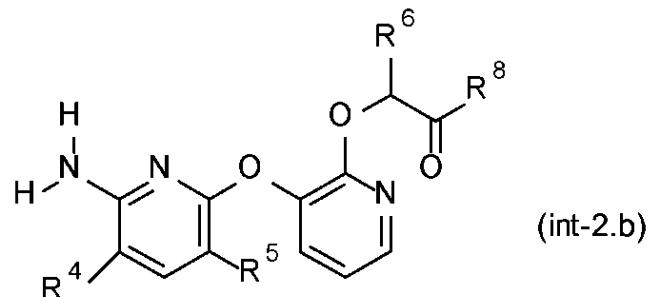
a.1) ~ (int-2.a.504)の中間体であり、可変要素R⁴、R⁵、R⁶及びR⁸の定義は、上の表Aに定義されているとおりである。

【0356】

同様に好ましいのは、ZがZ-7(R^a、R^b及びR^cがHである)であるという点においてのみ式(int-2.a.1) ~ (int-2.a.672)の対応する中間体と異なる、式(int-2.b)の中間体、好ましくは式(int-2.b.1) ~ (int-2.b.672)の中間体、特に好ましいのは、式(int-2.b.1) ~ (int-2.b.504)の中間体である:

【0357】

【化55】



10

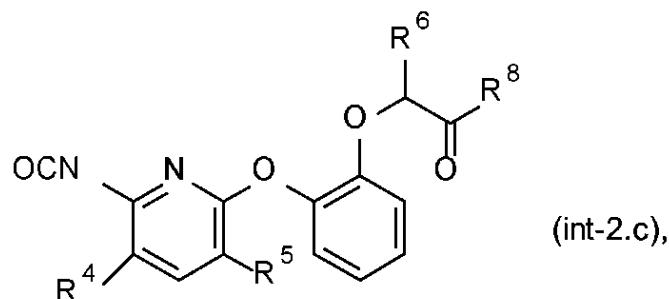
【0358】

同様に好ましいのは、I²とI³が、それらが結合しているN原子と一緒にになって、基「OCN」を形成するという点においてのみ式(int-2.a.1) ~ (int-2.a.672)の対応する中間体とは異なる、式(int-2.c)の中間体、好ましくは式(int-2.c.1) ~ (int-2.c.672)の中間体、特に好ましくは、式(int-2.c.1) ~ (int-2.c.504)の中間体である:

20

【0359】

【化56】



30

【0360】

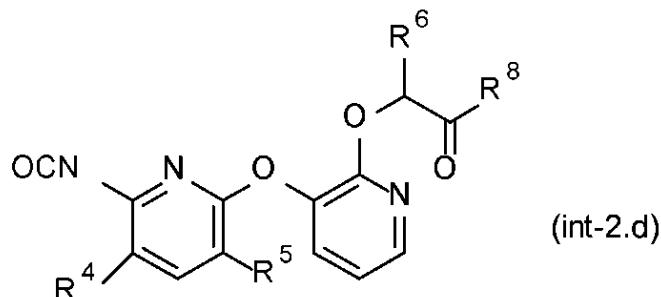
同様に好ましいのは、ZがZ-7(R^a、R^b及びR^cがHである)であり、I²とI³が、それらが結合しているN原子と一緒にになって、基「OCN」を形成するという点においてのみ式(int-2.a.1) ~ (int-2.a.672)の対応する中間体と異なる、式(int-2.d)の中間体、好ましくは式(int-2.d.1) ~ (int-2.d.672)の中間体、特に好ましいのは、式(int-2.d.1) ~ (int-2.d.504)の中間体である:

40

【0361】

50

【化57】

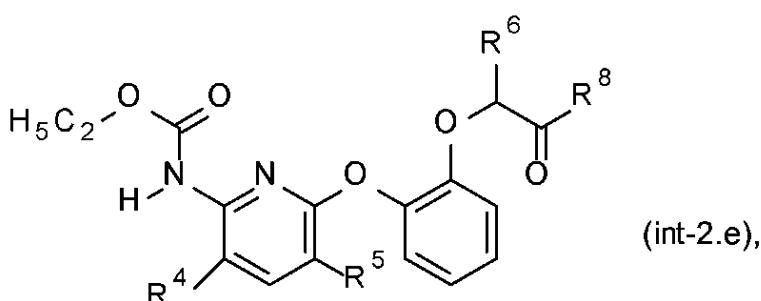


【0362】

同様に好ましいのは、I³が(CO)OC₂H₅であるという点においてのみ式(int-2.a.1)～(int-2.a.504)の対応する中間体と異なる、式(int-2.e)の中間体、好ましくは式(int-2.e.1)～(int-2.e.672)の中間体、特に好ましいのは、式(int-2.e.1)～(int-2.e.672)の中間体である：

【0363】

【化58】

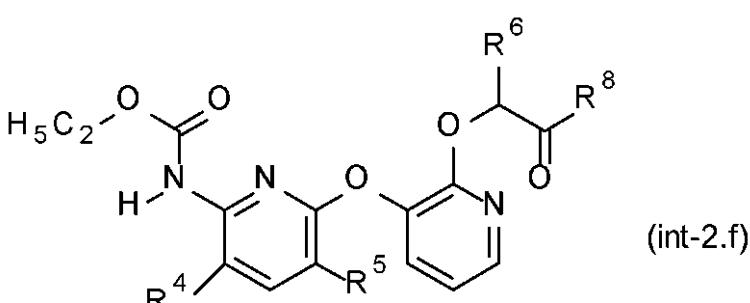


【0364】

同様に好ましいのは、ZがZ-7(R^a、R^b及びR^cは、Hである)であり、I³が(CO)OC₂H₅であるという点においてのみ式(int-2.a.1)～(int-2.a.672)の対応する中間体と異なる、式(int-2.f)の中間体、好ましくは式(int-2.f.1)～(int-2.f.672)の中間体、特に好ましいのは、式(int-2.f.1)～(int-2.f.504)の中間体である：

【0365】

【化59】



【0366】

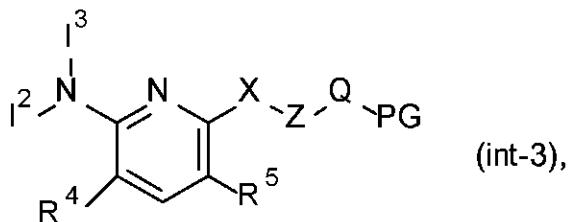
式(XX)の(チオ)カルバメート、式(XXIV)のイソ(チオ)シアネット、式(XXI)のアミン及び式(XXII)のピリジンを組み合わせた式(int-3)の中間体は、新規化合物であり、上で示されているとおり、本発明による式(I)のウラシルピリジンの調製に好適な中間体である。

【0367】

従って、本発明はまた、式(int-3)

【0368】

【化60】



[式中、置換基は以下の意味を有する:

R⁴は、H又はハロゲンであり;

R⁵は、ハロゲン、CN、NO₂、NH₂、CF₃又はC(=S)NH₂であり;

Qは、O、S、SO、SO₂、NH又は(C₁-C₃-アルキル)Nであり;

Xは、O又はSであり;

Zは、それぞれ、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシからなる群から選択される、1~4個の置換基により場合により置換されている、フェニル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル又はピラジニルであり;

PGは、

C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキオキシ-C₁-C₄-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シルクロアルキル-C₁-C₄-アルキル、C₅-C₆-シクロアルケニル、テトラヒドロピラニル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル、ホルミル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル、C₁-C₆-アルキル-O-カルボニル、C₂-C₆-アルケニル-O-カルボニル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル-C₁-C₄-アルキル、フェニル-C₁-C₄-アルキル、フェニルチオ-C₁-C₆-アルキル、フェニルカルボニル

からなる群から選択される保護基であり、

フェニル環はそれぞれ、ハロゲン、CN、NO₂、C₁-C₄-アルキル及びC₁-C₄-アルコキシからなる群から選択される1~3個の置換基により置換されていてもよく;

I²は、Hであり;

I³は、H又はC(=Y)L²であり、

Yは、O又はSであり、

L²は、求核的に置換可能な脱離基、好ましくはC₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ又はアリールオキシ(アリール部分は、それ自体、部分的に若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、並びに/又はシアノ、ニトロ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-アルキルチオからなる群からの1~3個の置換基により置換されていてもよい)であるか、

又はI²とI³は、それらが結合しているN原子と一緒にになって、基「YCN」(Yは、O又はSである)、

又は基「PGN」(これは、N₃、脂肪族又は芳香族カルバメート、脂肪族又は芳香族アミド、N-C₁-C₆-アルキル-アミン、N-アリール-アミン又はヘテロアリールアミドからなる群から選択される、保護アミン置換基である)を形成する]の中間体(それらの塩を含む)を提供する。

【0369】

好ましくは、

PGが、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、テトラヒドロピラニル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル又はフェニル-C₁-C₄-アルキルである、

10

20

30

40

50

式(int-3)の中間体である。

【0370】

好ましくは、

PGNが、N₃、C₁-C₆-アルキル-O(CO)NH-、C₁-C₆-ハロアルキル-O(CO)-NH-、(トリ-C₁-C₆-アルキル)-Si-C₁-C₆-アルキル-O(CO)NH-、C₂-C₆-アルケニル-O(CO)NH-、C₃-C₆-アルキニル-O(CO)NH-、C₃-C₆-シクロアルキル-O(CO)NH-、フルオレニルメチル-O(CO)NH-、H(CO)N-、C₁-C₆-アルキル-(CO)-NH-、C₁-C₆-ハロアルキル-(CO)-NH-、C₁-C₆-アルキル-NH、ジ(C₁-C₆-アルキル)-N-、(C₁-C₆-アルキオキシ-C₁-C₄-アルキル)NH-、ジ(C₁-C₆-アルキオキシ-C₁-C₄-アルキル)N-、C₂-C₆-アルケニル-NH、ジ(C₂-C₆-アルケニル)N-、(トリ-C₁-C₄-アルキル)-Si-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル-NH-、ジ[(トリ-C₁-C₄-アルキル)-Si-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル]N-、フルオレニルメチル-NH-、ジ(フルオレニルメチル)N-、N-フタルイミド、N-2,3-ジメチルマレイミド又はN-2,5-ジメチルピロール、フェニル-O(CO)NH-、フェニル-C₁-C₄-アルキル-O(CO)NH-、フェニル-(CO)NH-、フェニル-C₁-C₆-アルキル-(CO)NH-、ピリジル-(CO)-NH-、オルト-(C₁-C₄-アルコキシ)-フェニル-NH、ジ[オルト-(C₁-C₄-アルコキシ)-フェニル]N-、パラ-(C₁-C₄-アルコキシ)-フェニル-NH、ジ[パラ-(C₁-C₄-アルコキシ)-フェニル]N-、フェニル-C₁-C₄-アルキル-NH-、ジ(フェニル-C₁-C₄-アルキル)N-、パラ-(C₁-C₄-アルコキシ)-フェニル-C₁-C₄-アルキル-NH、ジ[パラ-(C₁-C₄-アルコキシ)-フェニル-C₁-C₄-アルキル]N-からなる群から選択され、

フェニル環又はピリジル環はそれぞれ、ハロゲン、CN、NO₂、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-アルキルスルフィニル及びC₁-C₄-アルキルスルホニルからなる群から選択される1~3個の置換基により置換されていてもよく；

より好ましくは、PGNが、C₁-C₆-アルキル-O(CO)NH-、フルオレニルメチル-O(CO)NH-、H(CO)N-、C₁-C₆-アルキル-(CO)-NH-、C₁-C₆-ハロアルキル-(CO)-NH、N-フタルイミド、フェニル-O(CO)NH-、フェニル-C₁-C₄-アルキル-O(CO)NH-、フェニル-C₁-C₄-アルキル-NH-、ジ(フェニル-C₁-C₄-アルキル)N-からなる群から選択され、

フェニル環又はピリジル環はそれぞれ、1~3個のC₁-C₄-アルコキシ置換基により置換されていてよい、

式(int-3)の中間体である。

【0371】

式(int-3)の中間体の好適な塩は、記載されるアミド又はカルバメート誘導体の、NH₄⁺、Li⁺、Na⁺、K⁺又はMg²⁺塩を含む。

【0372】

特に好ましくは、I²及びI³がHである、式(int-3)の中間体である。

【0373】

可変要素に関すると、式(int-3)の中間体の特に好ましい実施形態は、互いに独立して、若しくは互いに組み合わせて、式(I)のウラシルピリジンのR⁴、R⁵、Q、X、Y及びZの可変要素のものと対応するか、又は互いに独立して、若しくは互いに組み合わせて、以下の意味を有する：

R⁴は、H、F又はCIであり；

R⁵は、F、CI、Br又はCNであり；

Qは、O又はSであり；

Xは、Oであり；

Yは、Oであり；

Zは、上記に定義される、Z¹、Z⁴、Z⁵、Z⁶、Z⁷及びZ²¹からなる群から選択され、R^a、R^b、R^c、R^d及びR^eは、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシであり；

PGは、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキル、C₂-C₆-アルケニル又はテトラヒドロピラニルであり；

I²は、Hであり；

10

20

30

40

50

I^3 は、H又は $C(=Y)L^2$ であり、Yは、Oであり、 L^2 は、 C_1-C_5 -アルコキシであるか、又は I^2 と I^3 は、それらが結合しているN原子と一緒にになって、「YCN」から選択される基を形成し、YはOであり、

式(int-3)の中間体の塩を含み；

好ましくは、

R^4 は、H、F又はClであり；

R^5 は、F、Cl又はCNであり；

Qは、O又はSであり；

Xは、Oであり；

Yは、Oであり；

Zは、上記に定義される、 Z^1 、 Z^4 、 Z^5 、 Z^6 及び Z^7 からなる群から選択され、 R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 及び R^e は、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシであり；

PGは、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル又はテトラヒドロピラニルであり；

I^2 は、Hであり；

I^3 は、H又は $C(=Y)L^2$ であり、Yは、Oであり、 L^2 は、 C_1-C_5 -アルコキシであるか、又は I^2 と I^3 は、それらが結合しているN原子と一緒にになって、「YCN」から選択される基を形成し、YはOであり、

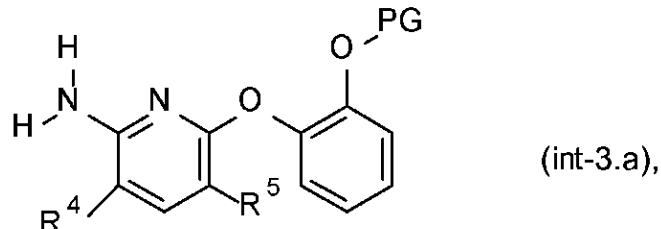
式(int-3)の中間体の塩を含む。

【0374】

特に好ましいのは、式(int-3.a)(Q及びXが、Oであり、Zが定義されているZ-1であり、 R^a 、 R^b 、 R^c 及び R^d が、Hであり、 I^2 及び I^3 が、Hである、式(int-3)に相当する)；

【0375】

【化61】



(式中、可変要素 R^4 、 R^5 及びPGは、上記に定義される意味、特に好ましい意味を有する)の中間体である。

【0376】

特に好ましいのは、表I-3の式(int-3.a.1)～(int-3.a.14)の中間体、好ましくは式(int-3.a.1)～(int-3.a.12)の中間体であり、可変要素 R^4 、 R^5 及びPGの定義は、互いに組み合わせてだけではなく、各場合においてそれ自体も、本発明による化合物にとって特に重要である。

【0377】

10

20

30

40

50

【表4】

表I-3

No.	R ⁴	R ⁵	PG
int-3.a.1.	H	F	CH ₃
int-3.a.2.	H	F	CH ₂ -C ₆ H ₅
int-3.a.3.	H	Cl	CH ₃
int-3.a.4.	H	Cl	CH ₂ -C ₆ H ₅
int-3.a.5.	H	CN	CH ₃
int-3.a.6.	H	CN	CH ₂ -C ₆ H ₅
int-3.a.7.	F	F	CH ₃
int-3.a.8.	F	F	CH ₂ -C ₆ H ₅
int-3.a.9.	F	Cl	CH ₃
int-3.a.10.	F	Cl	CH ₂ -C ₆ H ₅
int-3.a.11.	F	CN	CH ₃
int-3.a.12.	F	CN	CH ₂ -C ₆ H ₅
int-3.a.13.	H	Br	CH ₃
int-3.a.14.	F	Br	CH ₂ -C ₆ H ₅

10

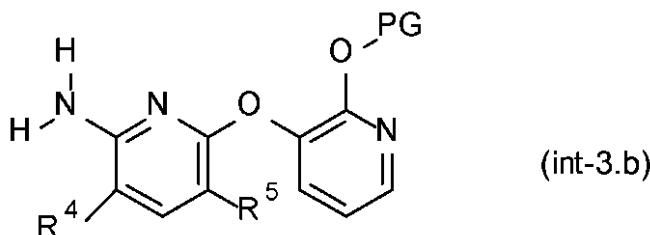
20

【0378】

同様に好ましいのは、ZがZ-7(R^a、R^b及びR^cは、Hである)であるという点においてのみ式(int-3.a.1)~(int-3.a.14)の対応する中間体と異なる、式(int-3.b)の中間体、好ましくは式(int-3.b.1)~(int-3.b.14)の中間体、特に好ましいのは、式(int-3.b.1)~(int-3.b.12)の中間体である：

【0379】

【化62】

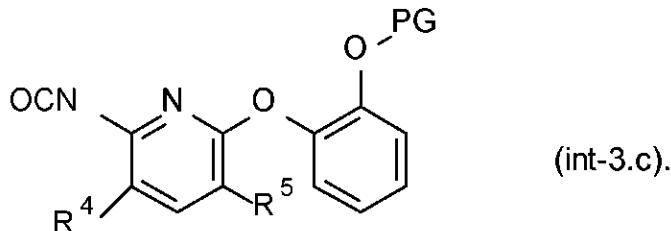


【0380】

同様に好ましいのは、I²とI³が、それらが結合しているN原子と一緒にになって、基「OCN」を形成するという点においてのみ式(int-3.a.1)~(int-3.a.14)の対応する中間体と異なる、式(int-3.c)の中間体、好ましくは式(int-3.c.1)~(int-3.c.14)の中間体、特に好ましいのは、式(int-3.c.1)~(int-3.c.12)の中間体である：

【0381】

【化63】



30

40

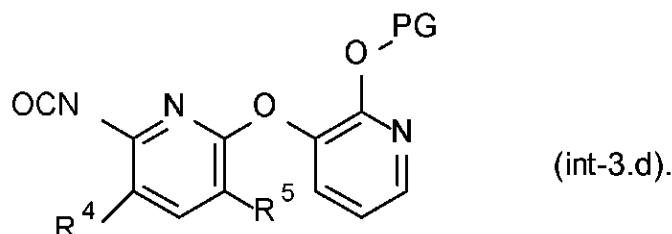
50

【0382】

同様に好ましいのは、ZがZ-7(R^a、R^b及びR^cは、Hである)であり、I²とI³が、それらが結合しているN原子と一緒にになって、基「OCN」を形成するという点においてのみ式(int-3.a.1)～(int-3.a.14)の対応する中間体と異なる、式(int-3.d)の中間体、好ましくは式(int-3.d.1)～(int-3.d.14)の中間体、特に好ましいのは、式(int-3.d.1)～(int-3.d.12)の中間体である:

【0383】

【化64】



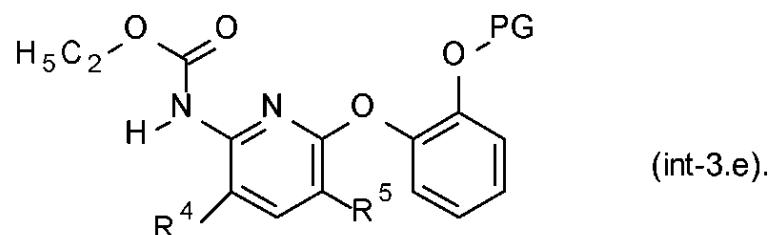
10

【0384】

同様に好ましいのは、I³が(CO)OC₂H₅であるという点においてのみ式(int-3.a.1)～(int-3.a.14)の対応する中間体と異なる、式(int-3.e)の中間体、好ましくは式(int-3.e.1)～(int-3.e.14)の中間体、特に好ましいのは、式(int-3.e.1)～(int-3.e.12)の中間体である:

【0385】

【化65】



20

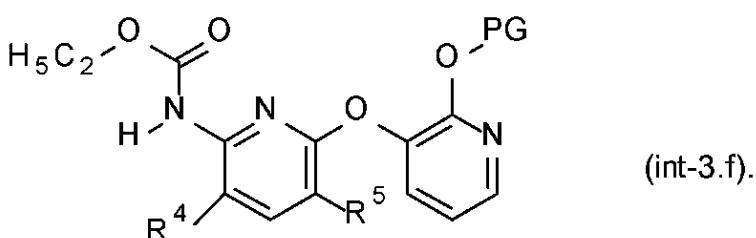
【0386】

30

同様に好ましいのは、ZがZ-7(R^a、R^b及びR^cは、Hである)であり、I³が(CO)OC₂H₅であるという点においてのみ式(int-3.a.1)～(int-3.a.14)の対応する中間体とは異なる、式(int-3.f)の中間体、好ましくは式(int-3.f.1)～(int-3.f.14)の中間体、特に好ましいのは、式(int-3.f.1)～(int-3.f.12)の中間体である:

【0387】

【化66】



40

【0388】

作用スペクトルを広げて相乗効果を得るために、式(I)のウラシルピリジンを他の除草活性成分群又は成長調節活性成分群の多数の代表例と混合し、その後同時に施用してもよい。混合物に適した成分は、例えば、アセトアミド系、アミド系、アリールオキシフェノキシプロピオン酸塩系、ベンズアミド系、ベンゾフラン系、安息香酸系、ベンゾチアジアジノン系、ビピリジリウム系、カルバメート系、クロロアセトアミド系、クロロカルボン酸系

50

、シクロヘキサンジオン系、ジニトロアニリン系、ジニトロフェノール系、ジフェニルエーテル系、グリシン系、イミダゾリノン系、イソオキサゾール系、イソオキサゾリジノン系、ニトリル系、N-フェニルフタルイミド系、オキサジアゾール系、オキサゾリジンジオン系、オキシアセトアミド系、フェノキシカルボン酸系、フェニルカルバメート系、フェニルピラゾール系、フェニルピラゾリン系、フェニルピリダジン系、ホスフィン酸系、ホスホロアミデート系、ホスホロジチオエート系、フタラメート系、ピラゾール系、ピリダジノン系、ピリジン系、ピリジンカルボン酸系、ピリジンカルボキサミド系、ピリミジンジオン系、ピリミジニル(チオ)安息香酸塩系、キノリンカルボン酸系、セミカルバゾン系、スルホニルアミノカルボニルトリアゾリノン系、スルホニル尿素系、テトラゾリノン系、チアジアゾール系、チオカルバメート系、トリアジン系、トリアジノン系、トリアゾール系、トリアゾリノン系、トリアゾロカルボキサミド系、トリアゾロピリミジン系、トリケトン系、ウラシル系、尿素系のクラスに属する除草剤である。

【0389】

式(I)のウラシルピリジンを、単独で、若しくは他の除草剤と組み合わせて、又はそうでない場合、他の作物保護剤との混合物の形態で、例えば、有害生物、又は植物病原性菌類若しくは細菌を防除するための薬剤と一緒に施用することがさらに有利であり得る。また、栄養不足及び微量元素不足を処置するために用いられる無機塩溶液との混和性も興味深い。非植物毒性の油及び油濃縮物などの他の添加物も、添加することができる。

【0390】

本発明の一実施形態において、本発明による組成物は、少なくとも1種の式(I)のウラシルピリジン(化合物A)、及び除草剤B、好ましくはクラスb1)~b15)の除草剤B、及び薬害軽減剤C(化合物C)から選択される、少なくとも1種のさらなる活性化合物を含む。

【0391】

本発明の別の実施形態において、本発明による組成物は、少なくとも1種の式(I)のウラシルピリジン及び少なくとも1種のさらなる活性化合物B(除草剤B)を含む。

【0392】

さらなる除草化合物B(成分B)は、好ましくは、クラスb1)~b15)の除草剤から選択される:

- b1) 脂質生合成阻害剤;
- b2) アセト乳酸シナーゼ阻害剤(ALS阻害剤);
- b3) 光合成阻害剤;
- b4) プロトポルフィリノーゲンIXオキシダーゼ阻害剤;
- b5) 白化除草剤;
- b6) エノールピルビルシキメート3-リン酸合成酵素阻害剤(EPSP阻害剤);
- b7) グルタミンシンテターゼ阻害剤;
- b8) 7,8-ジヒドロブテロエートシナーゼ阻害剤(DHP阻害剤);
- b9) 有糸分裂阻害剤;
- b10) 超長鎖脂肪酸合成阻害剤(VLCFA阻害剤);
- b11) セルロース生合成阻害剤;
- b12) デカップラー除草剤;
- b13) オーキシン除草剤;
- b14) オーキシン輸送阻害剤;及び
- b15) 以下のものからなる群から選択される他の除草剤:プロモブチド(bromobutide)、クロルフルレノール(chlorflurenol)、クロルフルレノール-メチル(chlorflurenol-methyl)、シンメチリン(cinmethylin)、クミルロン(cumyluron)、ダラポン(dalapon)、ダゾメト(dazomet)、ジフェンゾコート(difenoquat)、ジフェンゾコート-メチルサルフェート(difenoquat-metilsulfate)、ジメチピン(dimethipin)、DSMA、ダイムロン(dymron)、エンドタール(endothal)及びその塩、エトベンザニド(etobenzanid)、フラムプロップ(flamprop)、フラムプロップ-イソプロピル(flamprop-isopropyl)、フラムプロップ-メチル(flamprop-methyl)、フラムプロップ-M-イソプロピル(flamprop-M-isopropyl)

10

20

30

40

50

、フラムプロップ-M-メチル(flamprop-M-methyl)、フルレノール(flurenol)、フルレノール-ブチル(flurenol-butyl)、フルルプリミドール(flrprimidol)、ホサミン(fosamine)、ホサミン-アンモニウム(fosamine-ammonium)、インダノファン(indanofan)、インダジフラム(indaziflam)、マレイン酸ヒドラジド(maleic hydrazide)、メフルイジド(mefluidide)、メタム(metam)、メチオゾリン(methiozolin)(CAS403640-27-7)、メチルアジド(methyl azide)、臭化メチル、メチルダイムロン(methyl-dymron)、ヨウ化メチル、MSMA、オレイン酸、オキサジクロメホン(oxaziclomefone)、ペラルゴン酸、ピリブチカルブ(pyributicarb)、キノクラミン(quinoclamine)、トリアジフラム(triazi flam)、トリジファン(tridiphane)及び6-クロロ-3-(2-シクロプロピル-6-メチルフェノキシ)-4-ピリダジノール(CAS499223-49-3)並びにその塩及びエステル; 10 それらの農業上許容可能な塩又は誘導体を含む。

【0393】

クラスb2、b3、b4、b5、b6、b7、b9、b10及びb13の除草剤から選択される少なくとも1種の除草剤Bを含む本発明による組成物が好ましい。

【0394】

クラスb4、b6、b7、b9、b10及びb13の除草剤から選択される少なくとも1種の除草剤Bを含む本発明による組成物が特に好ましい。

【0395】

特に好ましいのは、クラスb4、b6、b10及びb13の除草剤から選択される少なくとも1種の除草剤Bを含む本発明による組成物である。 20

【0396】

本発明による式(I)の式(I)のウラシルピリジンと組み合わせて使用することができる除草剤Bの例は以下である:

【0397】

b1) 脂質生合成阻害剤の群から:

ACC-除草剤、例えばアロキシジム(alloxydim)、アロキシジム-ナトリウム(alloxydim-sodium)、ブトロキシジム(butroxydim)、クレトジム(clethodim)、クロジナホップ(clodinafop)、クロジナホップ-プロバルギル(clodinafop-propargyl)、シクロキシジム(cycloxydim)、シハロホップ(cyhalofop)、シハロホップ-ブチル(cyhalofop-butyl)、ジクロホップ(diclofop)、ジクロホップ-メチル(diclofop-methyl)、フェノキサプロップ(fenoxyprop)、フェノキサプロップ-エチル(fenoxyprop-ethyl)、フェノキサプロップ-P(fenoxyprop-P)、フェノキサプロップ-P-エチル(fenoxyprop-P-ethyl)、フルアジホップ(fluazifop)、フルアジホップ-ブチル(fluazifop-butyl)、フルアジホップ-P(fluazifop-P)、フルアジホップ-P-ブチル(fluazifop-P-butyl)、ハロキシホップ(haloxyfop)、ハロキシホップ-メチル(haloxyfop-methyl)、ハロキシホップ-P(haloxyfop-P)、ハロキシホップ-P-メチル(haloxyfop-P-methyl)、メタミホップ(metamifop)、ピノキサデン(pinodoxen)、プロホキシジム(profoxydim)、プロパキザホップ(propaquizafop)、キザロホップ(quizalofop)、キザロホップ-エチル(quizalofop-ethyl)、キザロホップ-テフリル(quizalofop-tefuryl)、キザロホップ-P(quizalofop-P)、キザロホップ-P-エチル(quizalofop-P-ethyl)、キザロホップ-P-テフリル(quizalofop-P-tefuryl)、セトキシジム(sethoxydim)、テプラロキシジム(tepraloxydim)、トラルコキシジム(tralkoxydim)、4-(4'-クロロ-4-シクロプロピル-2'-フルオロ[1,1'-ビフェニル]-3-イル)-5-ヒドロキシ-2,2,6,6-テトラメチル-2H-ピラン-3(6H)-オン(CAS1312337-72-6);4-(2',4'-ジクロロ-4-シクロプロピル[1,1'-ビフェニル]-3-イル)-5-ヒドロキシ-2,2,6,6-テトラメチル-2H-ピラン-3(6H)-オン(CAS1312337-45-3);4-(4'-クロロ-4-エチル-2'-フルオロ[1,1'-ビフェニル]-3-イル)-5-ヒドロキシ-2,2,6,6-テトラメチル-2H-ピラン-3(6H)-オン(CAS1033757-93-5);4-(2',4'-ジクロロ-4-エチル[1,1'-ビフェニル]-3-イル)-2,2,6,6-テトラメチル-2H-ピラン-3,5(4H,6H)-ジオン(CAS1312340-84-3);5-(アセチルオキシ)-4-(4'-クロロ-4-シクロプロピル-2'-フルオロ[1,1'-ビフェニル]-3-イル)-3,6-ジヒドロ-2,2,6,6-テトラメチル-2H-ピラン-3-オン(CAS1312337-48-6); 5-(アセチルオキシ)-4-(2',4'-ジクロロ-4-シク 40

10

20

30

40

50

ロプロピル-[1,1'-ビフェニル]-3-イル)-3,6-ジヒドロ-2,2,6,6-テトラメチル-2H-ピラン-3-オン;5-(アセチルオキシ)-4-(4'-クロロ-4-エチル-2'-フルオロ[1,1'-ビフェニル]-3-イル)-3,6-ジヒドロ-2,2,6,6-テトラメチル-2H-ピラン-3-オン(CAS1312340-82-1);5-(アセチルオキシ)-4-(2',4'-ジクロロ-4-エチル[1,1'-ビフェニル]-3-イル)-3,6-ジヒドロ-2,2,6,6-テトラメチル-2H-ピラン-3-オン(CAS1033760-55-2);4-(4'-クロロ-4-シクロプロピル-2'-フルオロ[1,1'-ビフェニル]-3-イル)-5,6-ジヒドロ-2,2,6,6-テトラメチル-5-オキソ-2H-ピラン-3-イル(カルボン酸メチルエステル(CAS1312337-51-1);4-(2',4'-ジクロロ-4-シクロプロピル-[1,1'-ビフェニル]-3-イル)-5,6-ジヒドロ-2,2,6,6-テトラメチル-5-オキソ-2H-ピラン-3-イル(カルボン酸メチルエステル;4-(4'-クロロ-4-エチル-2'-フルオロ[1,1'-ビフェニル]-3-イル)-5,6-ジヒドロ-2,2,6,6-テトラメチル-5-オキソ-2H-ピラン-3-イル(カルボン酸メチルエステル(CAS1312340-83-2);4-(2',4'-ジクロロ-4-エチル-[1,1'-ビフェニル]-3-イル)-5,6-ジヒドロ-2,2,6,6-テトラメチル-5-オキソ-2H-ピラン-3-イル(カルボン酸メチルエステル(CAS1033760-58-5);並びに非ACC除草剤、例えばベンフレセート(benfuresate)、ブチレート(butylate)、シクロエート(cycloate)、ダラポン(dalapon)、ジメピペレート(dimepiperate)、EPTC、エスプロカルブ(esprocarb)、エトフメセート(ethofumesate)、フルプロパネート(fluopropanate)、モリネート(molinate)、オルベンカルブ(orbencarb)、ペブレート(pebulate)、プロスルホカルブ(prosulfocarb)、TCA、チオベンカルブ(thiobencarb)、チオカルバジル(tiocarbazil)、トリアレート(triallate)及びベルノレート(vernolate);

【0398】

b2) ALS阻害剤の群から:

スルホニル尿素系、例えば、アミドスルフロン(amidosulfuron)、アジムスルフロン(azimsulfuron)、ベンスルフロン(bensulfuron)、ベンスルフロン-メチル(bensulfuron-methyl)、クロリムロン(chlorimuron)、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)、シクロスルファムロン(cyclosulfamuron)、エタメトスルフロン(ethametsulfuron)、エタメトスルフロン-メチル(ethametsulfuron-methyl)、エトキシスルフロン(ethoxysulfuron)、フラザスルフロン(flazasulfuron)、フルセトスルフロン(flucetosulfuron)、フルピルスルフロン(flupyralsulfuron)、フルピルスルフロン-メチル-ナトリウム(flupyralsulfuron-methyl-sodium)、ホラムスルフロン(foramsulfuron)、ハロスルフロン(halosulfuron)、ハロスルフロン-メチル(halosulfuron-methyl)、イマゾスルフロン(imazosulfuron)、ヨードスルフロン(iodosulfuron)、ヨードスルフロン-メチル-ナトリウム(iodosulfuron-methyl-sodium)、イオフェンスルフロン(iofensulfuron)、イオフェンスルフロン-ナトリウム(iofensulfuron-sodium)、メソスルフロン(mesosulfuron)、メタゾスルフロン(metazosulfuron)、メトスルフロン(metsulfuron)、メトスルフロン-メチル(metsulfuron-methyl)、ニコスルフロン(nicosulfuron)、オルトスルファムロン(orthosulfamuron)、オキサスルフロン(oxasulfuron)、プリミスルフロン(primisulfuron)、プリミスルフロン-メチル(primisulfuron-methyl)、プロピリスルフロン(propyrisulfuron)、プロスルフロン(prosulfuron)、ピラゾスルフロン(pyrazosulfuron)、ピラゾスルフロン-エチル(pyrazosulfuron-ethyl)、リムスルフロン(rimsulfuron)、スルホメツロン(sulfometuron)、スルホメツロン-メチル(sulfometuron-methyl)、スルホスルフロン(sulfosulfuron)、チフェンスルフロン(thifensulfuron)、チフェンスルフロン-メチル(thifensulfuron-methyl)、トリアスルフロン(triasulfuron)、トリベヌロン(tribenuron)、トリベヌロン-メチル(tribenuron-methyl)、トリフロキシスルフロン(trifloxyisulfuron)、トリフルスルフロン(triflusulfuron)、トリフルスルフロン-メチル(triflusulfuron-methyl)及びトリトスルフロン(tritosulfuron)。

イミダゾリノン系、例えばイマザメタベンズ(imazamethabenz)、イマザメタベンズ-メチル(imazamethabenz-methyl)、イマザモックス(imazamox)、イマザピック(imazapic)、イマザピル(imzapyr)、イマザキン(imazaquin)及びイマゼタピル(imazethapyr)、トリアゾロピリミジン(triazolopyrimidine)系除草剤及びスルホンアニリド系、例えば

10

20

30

40

50

クロランスラム(cloransulam)、クロランスラム-メチル(cloransulam-methyl)、ジクロスラム(diclosulam)、フルメツラム(flumetsulam)、フロラスラム(florasulam)、メトスラム(metosulam)、ペノキススラム(penoxsulam)、ピリミスルファン(pyrimisulfan)及びピロックススラム(pyroxsulam)、

ピリミジニルベンゾエート系、例えば、ビスピリバック(bispyribac)、ビスピリバック-ナトリウム(bispyribac-sodium)、ピリベンゾキシム(pyribenzoxim)、ピリフタリド(pyriftalid)、ピリミノバック(pyriminobac)、ピリミノバック-メチル(pyriminobac-methyl)、ピリチオバック(pyrithiobac)、ピリチオバック-ナトリウム(pyrithiobac-sodium)、4-[[2-[(4,6-ジメトキシ-2-ピリミジニル)オキシ]フェニル]メチル]アミノ]-安息香酸-1-メチルエチルエステル(CAS420138-41-6)、4-[[2-[(4,6-ジメトキシ-2-ピリミジニル)オキシ]フェニル]-メチル]アミノ]-安息香酸プロピルエステル(CAS420138-40-5)、N-(4-プロモフェニル)-2-[(4,6-ジメトキシ-2-ピリミジニル)オキシ]ベンゼンメタンアミン(CAS420138-01-8)、

スルホニルアミノカルボニル-トリアゾリノン系除草剤、例えば、フルカルバゾン(flucarbazone)、フルカルバゾン-ナトリウム(flucarbazone-sodium)、プロポキシカルバゾン(propoxycarbazone)、プロポキシカルバゾン-ナトリウム(propoxycarbazone-sodium)、チエンカルバゾン(thiencarbazone)及びチエンカルバゾン-メチル(thiencarbazone-methyl);並びにトリアファモン(trifamone)。

これらの中でも、本発明の好ましい実施形態は、少なくとも1種のイミダゾリノン系除草剤を含む組成物に関する;

【0399】

b3) 光合成阻害剤の群から:

アミカルバゾン(amicarbazone)、光化学系IIの阻害剤、例えば1-(6-tert-ブチルピリミジン-4-イル)-2-ヒドロキシ-4-メトキシ-3-メチル-2H-ピロール-5-オン(CAS 1654744-66-7)、1-(5-tert-ブチルイソオキサゾール-3-イル)-2-ヒドロキシ-4-メトキシ-3-メチル-2H-ピロール-5-オン(CAS 1637455-12-9)、1-(5-tert-ブチルイソオキサゾール-3-イル)-4-クロロ-2-ヒドロキシ-3-メチル-2H-ピロール-5-オン(CAS 1637453-94-1)、1-(5-tert-ブチル-1-メチル-ピラゾール-3-イル)-4-クロロ-2-ヒドロキシ-3-メチル-2H-ピロール-5-オン(CAS 1654057-29-0)、1-(5-tert-ブチル-1-メチル-ピラゾール-3-イル)-3-クロロ-2-ヒドロキシ-4-メチル-2H-ピロール-5-オン(CAS 1654747-80-4)、4-ヒドロキシ-1-メトキシ-5-メチル-3-[4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]イミダゾリジン-2-オン;(CAS 2023785-78-4)、4-ヒドロキシ-1,5-ジメチル-3-[4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]イミダゾリジン-2-オン(CAS 2023785-79-5)、5-エトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-3-[4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]イミダゾリジン-2-オン(CAS 1701416-69-4)、4-ヒドロキシ-1-メチル-3-[4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]イミダゾリジン-2-オン(CAS 1708087-22-2)、4-ヒドロキシ-1,5-ジメチル-3-[1-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-イル]イミダゾリジン-2-オン(CAS 2023785-80-8)、1-(5-tert-ブチルイソオキサゾール-3-イル)-4-エトキシ-5-ヒドロキシ-3-メチル-イミダゾリジン-2-オン(CAS 1844836-64-1)、クロロトリアジン(chlorotriazine)系、トリアジノン(triazinone)系、トリアジンジオン(triazindione)系、メチルチオトリアジン(methylthiotriazine)系及びピリダジノン(pyridazinone)系などのトリアジン(triazine)系除草剤、例えばアメトリン(ametryn)、アトラジン(atrazine)、クロリダゾン(chloridazone)、シアナジン(cyanazine)、デスマトリン(desmetryn)、ジメタメトリン(dimethametryn)、ヘキサジノン(hexazinone)、メトリブジン(metribuzin)、プロメトン(prometon)、プロメトリン(prometryn)、プロパジン(propazine)、シマジン(simazine)、シメトリン(simetryn)、テルブメトン(terbumeton)、テルブチラジン(terbuthylazin)、テルブトリン(terbutryn)及びトリエタジン(trietazin)、アリール尿素系、例えばクロロプロムロン(chlorobromuron)、クロロトルロン(chlorotoluron)、クロロクスロン(chloroxuron)、ジメフロン(dimefuron)、ジウロン(diuron)、フルオメツロン(fluometuron)、イソプロツロン(isoproturon)、イソウロン(isouron)、リニュロン(linuron)、メタミトロン(metamitro

10

20

30

40

50

n)、メタベンズチアズロン(methabenzthiazuron)、メトベンズロン(metobenzuron)、メトクスロン(metoxuron)、モノリニュロン(monolinuron)、ネブロン(neburon)、シデュロン(siduron)、テブチウロン(tebuthiuron)及びチアジアズロン(thiadiazuron)、フェニルカルバメート系、例えばデスマディファム(desmedipham)、カルブチレート(carbutilat)、フェンメジファム(phenmedipham)、フェンメジファム-エチル(phenmedipham-ethyl)、ニトリル系除草剤、例えばブロモフェノキシム(bromofenoxim)、ブロモキシニル(bromoxynil)並びにその塩及びエステル、アイオキシニル(ioxynil)並びにその塩及びエステル、ウラシル系、例えばブロマシル(bromacil)、レナシル(lenacil)及びテルバシル(terbacil)、並びにベンタゾン(bentazon)及びベンタゾン-ナトリウム(bentazon-sodium)、ピリデート(pyridate)、ピリダフォル(pyridafol)、ベンタノクロル(pentachlor)及びプロパニル(propanil)並びに光化学系Iの阻害剤、例えばジクワット(diquat)、ジクワット-ジブロミド(diquat-dibromide)、パラコート(paraquat)、パラコート-ジクロリド(paraquat-dichloride)及びパラコート-ジメチルスルフェート(paraquat-dimethylsulfate)。これらの中でも、本発明の好ましい実施形態は、少なくとも1種のアリール尿素系除草剤を含む組成物に関する。これらの中でも、同様に本発明の好ましい実施形態は、少なくとも1種のトリアジン系除草剤を含む組成物に関する。これらの中でも、同様に本発明の好ましい実施形態は、少なくとも1種のニトリル系除草剤を含む組成物に関する;

【0400】

b4) プロトポルフィリノーゲン-IXオキシダーゼ阻害剤の群から:

アシフルオルフェン(acifluorfen)、アシフルオルフェン-ナトリウム(acifluorfen-sodium)、アザフェニジン(azafenidin)、ベンカルバゾン(bencarbazone)、ベンズフェンジゾン(benzfendizone)、ビフェノックス(bifenox)、ブタフェナシル(butafenacil)、カルフェントラゾン(carfentrazone)、カルフェントラゾン-エチル(carfentrazone-ethyl)、クロメトキシフェン(chlomethoxyfen)、クロルフタリム(chlorphthalim)、シニドン-エチル(cinidon-ethyl)、フルアゾレート(fluazolate)、フルフェンピル(flufenpyr)、フルフェンピル-エチル(flufenpyr-ethyl)、フルミクロラック(flumiclorac)、フルミクロラック-ペニチル(flumiclorac-pentyl)、フルミオキサジン(flumioxazin)、フルオログリコフェン(fluoroglycofen)、フルオログリコフェン-エチル(fluoroglycofen-ethyl)、フルチアセット(fluthiacet)、フルチアセット-メチル(fluthiacet-methyl)、ホメサafen(fomesafen)、ハロサafen(halosafen)、ラクトフェン(lactofen)、オキサジアルギル(oxadiargyl)、オキサジアゾン(oxadiazon)、オキシフルオルフェン(oxyfluorfen)、ペントキサゾン(pentoxazone)、プロフルアゾール(profluazol)、ピラクロニル(pyraclonil)、ピラフルフェン(pyraflufen)、ピラフルフェン-エチル(pyraflufen-ethyl)、サフルフェナシル(saflufenacil)、スルフェントラゾン(sulfentrazone)、チジアジミン(thidiazimin)、チアフェナシル(tiafenacil)、トリフルジモキサジン(trifludimoxazin)、エチル[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]アセテート(CAS353292-31-6; S-3100)、N-エチル-3-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)-5-メチル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド(CAS452098-92-9)、N-テトラヒドロフルフリル-3-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)-5-メチル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド(CAS915396-43-9)、N-エチル-3-(2-クロロ-6-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)-5-メチル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド(CAS452099-05-7)、N-テトラヒドロフルフリル-3-(2-クロロ-6-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)-5-メチル-1H-ピラゾール-1-カルボキサミド(CAS452100-03-7)、3-[7-フルオロ-3-オキソ-4-(プロパ-2-イニル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル]-1,5-ジメチル-6-チオキソ-[1,3,5]トリアジナン-2,4-ジオン(CAS451484-50-7)、2-(2,2,7-トリフルオロ-3-オキソ-4-プロパ-2-イニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-イソインドール-1,3-ジオン(CAS1300118-96-0)、1-メチル-6-トリフルオロメチル-3-(2,2,7-トリフルオロ-3-オキソ-4-プロパ-2-イニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]

10

20

30

40

50

オキサジン-6-イル)-1H-ピリミジン-2,4-ジオン(CAS1304113-05-0)、メチル(E)-4-[2-クロロ-5-[4-クロロ-5-(ジフルオロメトキシ)-1H-メチル-ピラゾール-3-イル]-4-フルオロ-フェノキシ]-3-メトキシ-ブタ-2-エノエート(CAS948893-00-3)、及び3-[7-クロロ-5-フルオロ-2-(トリフルオロメチル)-1H-ベンゾイミダゾール-4-イル]-1-メチル-6-(トリフルオロメチル)-1H-ピリミジン-2,4-ジオン(CAS212754-02-4);

【0401】

b5) 白化除草剤の群から:

PDS阻害剤:ベフルブタミド(beflubutamid)、ジフルフェニカン(diflufenican)、フルリドン(fluridone)、フルロクロリドン(flurochloridone)、フルルタモン(flurtamone)、ノルフルラゾン(norflurazon)、ピコリナafen(picolinafen)、及び4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)-2-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピリミジン(CAS180608-33-7)、HPPD阻害剤:ベンゾビシクロン(benzobicyclon)、ベンゾフェナップ(benzofenap)、ビシクロピロン(bicyclopionate)、クロマゾン(clomazone)、フェンキノトリオン(fenquinotriione)、イソキサフルトール(isoxaflutole)、メソトリオン(mesotriione)、オキソトリオン(oxotriione)(CAS1486617-21-3)、ピラスルホトール(pyrasulfotole)、ピラゾリネート(pyrazolynate)、ピラゾキシフェン(pyrazoxyfen)、スルコトリオン(sulcotriione)、テフリルトリオン(tefuryltrione)、テンボトリオン(tembotriione)、トルピラレート(tolpyralate)、トプラメゾン(topramezone)、白化剤、未知の標的:アクロニフェン(aclonifen)、アミトロール(amitrole)、フルメツロン(flumeturon)及び2-クロロ-3-メチルスルファニル-N-(1-メチルテトラゾール-5-イル)-4-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(CAS 1361139-71-0)、2-(2,4-ジクロロフェニル)メチル-4,4-ジメチル-3-イソオキサゾリドン(CAS 81777-95-9)及び2-(2,5-ジクロロフェニル)メチル-4,4-ジメチル-3-イソオキサゾリジノン(CAS 81778-66-7);

【0402】

b6) EPSPシンターゼ阻害剤の群から:

グリホサート(glyphosate)、グリホサート-イソプロピルアンモニウム(glyphosate-isopropylammonium)、グリホサート-カリウム(glyposate-potassium)及びグリホサート-トリメシウム(glyphosate-trimesium)(スルホサート(sulfosate));

【0403】

b7) グルタミンシナーゼ阻害剤の群から:

ビラナホス(bilanaphos)(ビアラホス(bialaphos))、ビラナホス-ナトリウム(bilanaphos-sodium)、グルホシネート(glufosinate)、グルホシネート-P(glufosinate-P)及びグルホシネート-アンモニウム(glufosinate-ammonium);

【0404】

b8) DHPシナーゼ阻害剤の群から:

アスラム(asulam);

【0405】

b9) 有糸分裂阻害剤の群から:

群K1の化合物:ジニトロアニリン系、例えばベンフルラリン(benfluralin)、ブトラリン(butralin)、ジニトラミン(dinitramine)、エタルフルラリン(ethalfluralin)、フルキロラリン(fluchlralin)、オリザリン(oryzalin)、ベンジメタリン(pendimethalin)、プロジアミン(prodiamine)及びトリフルラリン(trifluralin)、ホスホロアミデート系、例えばアミプロホス(amiprotophos)、アミプロホス-メチル(amiprotophos-methyl)及びブタミフォス(butamiphos)、安息香酸除草剤、例えばクロルタール(chlorthal)、クロルタール-ジメチル(chlorthal-dimethyl)、ピリジン系、例えばジチオピル(dithiopyr)及びチアゾピル(thiazopyr)、ベンズアミド系、例えばプロピザミド(propyzamide)及びテブタム(tebutam);群K2の化合物:カルベタミド(carbetamide)、クロルプロファム(chlorpropham)、フラムプロップ(flamprop)、フラムプロップ-イソプロピル(flamprop-isopropyl)、フラムプロップ-メチル(flamprop-methyl)、フラムプロップ-M-イソプロピル(flamprop-M-isopropyl)、フラムプロップ-M-メチル(flamprop-M-methyl)及びプロファム(prop

10

20

20

30

40

50

ham)、これらの中でも、群K1の化合物、特にジニトロアニリン系が好ましい;

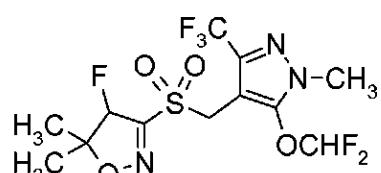
【0406】

b10) VLCFA阻害剤の群から:

クロロアセトアミド系、例えばアセトクロール(acetochlor)、アラクロール(alachlor)、アミドクロール(amidochlor)、ブタクロール(butachlor)、ジメタクロール(dimethachlor)、ジメテナミド(dimethenamid)、ジメテナミド-P(dimethenamid-P)、メタザクロール(metazachlor)、メトラクロール(metolachlor)、メトラクロール-S(metolachlor-S)、ペトキサミド(pethoxamid)、プレチラクロール(pretilachlor)、プロパクロール(propachlor)、プロピソクロール(propisochlor)及びテニルクロール(thenylchlor)、オキシアセトアニリド系、例えばフルフェナセット(flufenacet)及びメフェナセット(mefenacet)、アセトアニリド系(acetanilides)、例えばジフェナミド(diphenamid)、ナプロアニリド(naproanilide)、ナプロパミド(napropamide)及びナプロパミド-M(napropamide-M)、テトラゾリノン系、例えばフェントラザミド(fentrazamide)、並びに他の除草剤、例えばアニロホス(anilofos)、カフェンストロール(cafenstrole)、フェノキサスルホン(fenoxasulfone)、イプフェンカルバゾン(ipfencarbazone)、ピペロホス(piperophos)、ピロキサスルホン(pyroxasulfone)、並びに式II.1、II.2、II.3、II.4、II.5、II.6、II.7、II.8、及びII.9:

【0407】

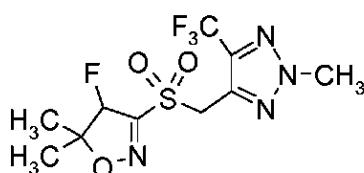
【化67】



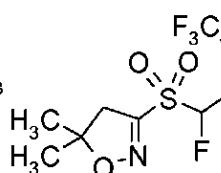
II.1



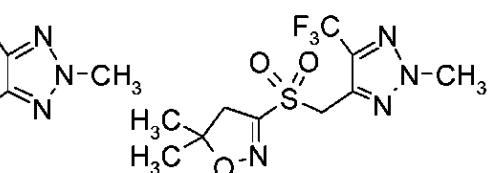
II.2



II.3



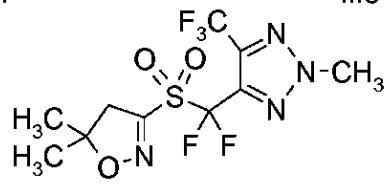
II.4



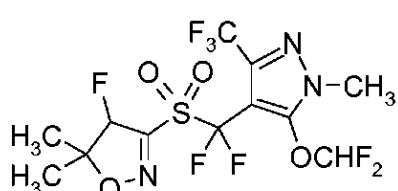
II.5



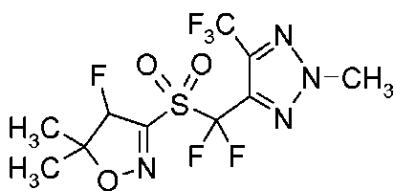
II.6



II.7



II.8



II.9

10

20

30

40

50

で表されるイソオキサゾリン化合物、

(式(I)Iのイソオキサゾリン化合物は、例えば、WO 2006/024820、WO 2006/037945、WO 2007/071900及びWO 2007/096576から当技術分野において公知である);

VLCFA阻害剤の中でも、クロロアセトアミド系及びオキシアセトアミド系が好ましい;

【0408】

b11) セルロース生合成阻害剤の群から:

クロルチアミド(chlorthiamid)、ジクロベニル(dichlobenil)、フルポキサム(fluopoxam)、インダジフラム(indaziflam)、イソキサベン(isoxaben)、トリアジフラム(triaziflam)、及び1-シクロヘキシル-5-ペンタフルオロフェニルオキシ-1⁴-[1,2,4,6]チアトリアジン-3-イルアミン(CAS175899-01-1);

10

【0409】

b12) デカッブラー除草剤の群から:

ジノセブ(dinoseb)、ジノテルブ(dinoterb)並びにDNOC及びその塩;

【0410】

b13) オーキシン除草剤の群から:

2,4-D並びにその塩及びエステル、例えばクラシフォス(clacyfos)、2,4-DB並びにその塩及びエステル、アミノシクロピラクロール(aminocyclopyrachlor)並びにその塩及びエステル、アミノピラリド(aminopyralid)並びにその塩、例えばアミノピラリド-ジメチルアンモニウム、アミノピラリド-トリス(2-ヒドロキシプロピル)アンモニウム及びそのエステル、ベナゾリン(benazolin)、ベナゾリン-エチル(benazolin-ethyl)、クロランベン(chloramben)並びにその塩及びエステル、クロメプロップ(clomeprop)、クロピラリド(clopyralid)並びにその塩及びエステル、ジカンバ(dicamba)並びにその塩及びエステル、ジクロルプロップ(dichlorprop)並びにその塩及びエステル、ジクロルプロップ-P(dichlorprop-P)並びにその塩及びエステル、フロピラウキシフェン(flopyrauxifen)、フルロキシピル(fluroxypyrr)、フルロキシピル-ブトメチル(fluroxypyrr-butometyl)、フルロキシピル-メチル(fluroxypyrr-methyl)、ハラウキシフェン(halauxifen)並びにその塩及びエステル(CAS943832-60-8); MCPA並びにその塩及びエステル、MCPA-チオエチル、MCPB並びにその塩及びエステル、メコプロップ(mecoprop)並びにその塩及びエステル、メコプロップ-P(mecoprop-P)並びにその塩及びエステル、ピクロラム(picloram)並びにその塩及びエステル、キンクロラック(quinclorac)、キンメラック(quinmerac)、TBA(2,3,6)並びにその塩及びエステル、トリクロピル(triclopyr)並びにその塩及びエステル、フルルピラウキシフェン(florpyrauxifen)、フルルピラウキシフェン-ベンジル(CAS1390661-72-9)及び4-アミノ-3-クロロ-5-フルオロ-6-(7-フルオロ-1H-インドール-6-イル)ピコリン酸(CAS1629965-65-6);

20

【0411】

b14) オーキシン輸送阻害剤の群から:ジフルフェンゾピル(diflufenzoypyr)、ジフルフェンゾピル-ナトリウム(diflufenzoypyr-sodium)、ナプタラム(naptalam)及びナプタラム-ナトリウム(naptalam-sodium);

30

【0412】

b15) 他の除草剤の群から:ブロモブチド(bromobutide)、クロルフルレノール(chlorflurenol)、クロルフルレノール-メチル(chlorflurenol-methyl)、シンメチリン(cinmethylin)、クミルロン(cumyluron)、シクロピリモレート(cyclopyrimorate)(CAS499223-49-3)並びにその塩及びエステル、ダラポン(dalapon)、ダゾメット(dazomet)、ジフェンゾコート(difenoquat)、ジフェンゾコート-メチルスルフェート(difenoquat-methylsulfate)、ジメチピン(dimethipin)、DSMA、ダイムロン(dymron)、エンドタール(endothal)及びその塩、エトベンザニド(etobenzanid)、フルレノール(flurenol)、フルレノール-ブチル(flurenol-butyl)、フルルプリミドール(furprimidol)、ホサミン(fosamine)、ホサミン-アンモニウム(fosamine-ammonium)、インダノファン(indanofan)、マレイイン酸ヒドラジド(maleic hydrazide)、メフルイジド(mefluidide)、メタム(metam)、メチオゾリン(methiozolin)(CAS403640-27-7)、メチルアジド(methyl azide)、メチ

40

50

ルプロミド(methyl bromide)、メチル-ダイムロン(methyl-dymron)、メチルヨージド(methyl iodide)、MSMA、オレイン酸(oleic acid)、オキサジクロメホン(oxaziclomef one)、ペラルゴン酸(pelargonic acid)、ピリブチカルブ(pyributicarb)、キノクラミン(quinoclamine)及びトリジファン(tridiphane)。

【0413】

カルボキシリル基を有する活性化合物B及びCは、本発明による組成物において、酸の形態で、上記の農業上適した塩の形態で、あるいは農業上許容可能な誘導体の形態で用いることができる。

【0414】

ジカンバの場合、好適な塩としては、例えば、対イオンが農業上許容可能なカチオンである塩が挙げられる。例えば、ジカンバの好適な塩は、ジカンバ-ナトリウム、ジカンバ-カリウム、ジカンバ-メチルアンモニウム、ジカンバ-ジメチルアンモニウム、ジカンバ-イソプロピルアンモニウム、ジカンバ-ジグリコールアミン、ジカンバ-オールアミン、ジカンバ-ジオールアミン、ジカンバ-トロールアミン、ジカンバ-N,N-ビス-(3-アミノプロピル)メチルアミン及びジカンバ-ジエチレントリアミンである。好適なエステルの例は、ジカンバ-メチル及びジカンバ-ブトチルである。

【0415】

2,4-Dの好適な塩は、2,4-D-アンモニウム、2,4-D-ジメチルアンモニウム、2,4-D-ジエチルアンモニウム、2,4-D-ジエタノールアンモニウム(2,4-D-ジオールアミン)、2,4-D-トリエタノールアンモニウム、2,4-D-イソプロピルアンモニウム、2,4-D-トリイソプロパノールアンモニウム、2,4-D-ヘプチルアンモニウム、2,4-D-ドデシルアンモニウム、2,4-D-テトラデシルアンモニウム、2,4-D-トリエチルアンモニウム、2,4-D-トリス(2-ヒドロキシプロピル)アンモニウム、2,4-D-トリス(イソプロピル)アンモニウム、2,4-D-トロールアミン、2,4-D-リチウム、2,4-D-ナトリウムである。2,4-Dの好適なエステルの例は、2,4-D-ブトチル、2,4-D-2-ブトキシプロピル、2,4-D-3-ブトキシプロピル、2,4-D-ブチル、2,4-D-エチル、2,4-D-エチルヘキシル、2,4-D-イソブチル、2,4-D-イソオクチル、2,4-D-イソプロピル、2,4-D-メブチル、2,4-D-メチル、2,4-D-オクチル、2,4-D-ペンチル、2,4-D-プロピル、2,4-D-テフリル及びクラシホスである。

【0416】

2,4-DBの好適な塩は、例えば、2,4-DB-ナトリウム、2,4-DB-カリウム及び2,4-DB-ジメチルアンモニウムである。2,4-DBの好適なエステルは、例えば、2,4-DB-ブチル及び2,4-DB-イソオクチルである。

【0417】

ジクロルプロップの好適な塩は、例えば、ジクロルプロップ-ナトリウム、ジクロルプロップ-カリウム及びジクロルプロップ-ジメチルアンモニウムである。ジクロルプロップの好適なエステルの例は、ジクロルプロップ-ブチル及びジクロルプロップ-イソオクチルである。

【0418】

MCPPAの好適な塩及びエステルとしては、例えば、MCPPA-ブチル、MCPPA-ブチル、MCPPA-ジメチルアンモニウム、MCPPA-ジオールアミン、MCPPA-エチル、MCPPA-チオエチル、MCPPA-2-エチルヘキシル、MCPPA-イソブチル、MCPPA-イソオクチル、MCPPA-イソプロピル、MCPPA-イソプロピルアンモニウム、MCPPA-メチル、MCPPA-オールアミン、MCPPA-カリウム、MCPPA-ナトリウム及びMCPPA-トロールアミンが挙げられる。

【0419】

MCPPBの好適な塩は、MCPPBナトリウムである。MCPPBの好適なエステルは、MCPPB-エチルである。

【0420】

クロピラリドの好適な塩は、クロピラリド-カリウム、クロピラリド-オールアミン及びクロピラリド-トリス-(2-ヒドロキシプロピル)アンモニウムである。クロピラリドの好適なエステルの例は、クロピラリド-メチルである。

10

20

30

40

50

【0421】

フルロキシピルの好適なエステルの例は、フルロキシピル-メチル及びフルロキシピル-2-ブトキシ-1-メチルエチルであり、フルロキシピル-メチルが好ましい。

【0422】

ピクロラムの好適な塩は、ピクロラム-ジメチルアンモニウム、ピクロラム-カリウム、ピクロラム-トリイソプロパノールアンモニウム、ピクロラム-トリイソプロピルアンモニウム及びピクロラム-トロールアミンである。ピクロラムの好適なエステルは、ピクロラム-イソオクチルである。

【0423】

トリクロピルの好適な塩は、トリクロピル-トリエチルアンモニウムである。トリクロピルの好適なエステルは、例えば、トリクロピル-エチル及びトリクロピル-ブチルである。

【0424】

クロランベンの好適な塩及びエステルとしては、例えば、クロランベン-アンモニウム、クロランベン-ジオールアミン、クロランベン-メチル、クロランベン-メチルアンモニウム及びクロランベン-ナトリウムが挙げられる。2,3,6-TBAの好適な塩及びエステルとしては、例えば、2,3,6-TBA-ジメチルアンモニウム、2,3,6-TBA-リチウム、2,3,6-TBA-カリウム及び2,3,6-TBA-ナトリウムが挙げられる。

【0425】

アミノピラリドの好適な塩及びエステルとしては、例えば、アミノピラリド-カリウム、アミノピラリド-ジメチルアンモニウム、及びアミノピラリド-トリス(2-ヒドロキシプロピル)アンモニウムが挙げられる。

【0426】

グリホサートの好適な塩は、例えば、グリホサート-アンモニウム、グリホサート-ジアンモニウム、グリホサート-ジメチルアンモニウム、グリホサート-イソプロピルアンモニウム、グリホサート-カリウム、グリホサート-ナトリウム、グリホサート-トリメシウム並びにエタノールアミン及びジエタノールアミン塩、好ましくはグリホサート-ジアンモニウム、グリホサート-イソプロピルアンモニウム及びグリホサート-トリメシウム(スルホサート)である。

【0427】

グルホシネットの好適な塩は、例えば、グルホシネット-アンモニウムである。

【0428】

グルホシネット-Pの好適な塩は、例えば、グルホシネット-P-アンモニウムである。

【0429】

プロモキシニルの好適な塩及びエステルは、例えば、プロモキシニル-ブチレート、プロモキシニル-ヘプタノエート、プロモキシニル-オクタノエート、プロモキシニル-カリウム及びプロモキシニル-ナトリウムである。

【0430】

アイオキソニルの好適な塩及びエステルは、例えば、アイオキソニル-オクタノエート、アイオキソニル-カリウム及びアイオキソニル-ナトリウムである。

【0431】

メコプロップの好適な塩及びエステルとしては、例えば、メコプロップ-ブチル、メコプロップ-ジメチルアンモニウム、メコプロップ-ジオールアミン、メコプロップ-エタジル、メコプロップ-2-エチルヘキシル、メコプロップ-イソオクチル、メコプロップ-メチル、メコプロップ-カリウム、メコプロップ-ナトリウム及びメコプロップ-トロールアミンが挙げられる。

【0432】

メコプロップ-Pの好適な塩は、例えば、メコプロップ-P-ブチル、メコプロップ-P-ジメチルアンモニウム、メコプロップ-P-2-エチルヘキシル、メコプロップ-P-イソブチル、メコプロップ-P-カリウム及びメコプロップ-P-ナトリウムである。

【0433】

10

20

30

40

50

ジフルフェンゾピルの好適な塩は、例えば、ジフルフェンゾピル-ナトリウムである。

【0434】

ナプタラムの好適な塩は、例えば、ナプタラム-ナトリウムである。

【0435】

アミノシクロピラクロールの好適な塩及びエステルは、例えば、アミノシクロピラクロール-ジメチルアンモニウム、アミノシクロピラクロール-メチル、アミノシクロピラクロール-トリイソプロパノールアンモニウム、アミノシクロピラクロール-ナトリウム及びアミノシクロピラクロール-カリウムである。

【0436】

キンクロラックの好適な塩は、例えば、キンクロラック-ジメチルアンモニウムである。

10

【0437】

キンメラックの好適な塩は、例えば、キンクロラック-ジメチルアンモニウムである。

【0438】

イマザモックスの好適な塩は、例えば、イマザモックス-アンモニウムである。

【0439】

イマザピックの好適な塩は、例えば、イマザピック-アンモニウム及びイマザピック-イソプロピルアンモニウムである。

【0440】

イマザピルの好適な塩は、例えば、イマザピル-アンモニウム及びイマザピル-イソプロピルアンモニウムである。

20

【0441】

イマザキンの好適な塩は、例えば、イマザキン-アンモニウムである。

【0442】

イマゼタピルの好適な塩は、例えば、イマゼタピル-アンモニウム及びイマゼタピル-イソプロピルアンモニウムである。

【0443】

トプラメゾンの好適な塩は、例えば、トプラメゾン-ナトリウムである。

【0444】

特に好ましい除草剤Bは、上記に定義される除草剤B;特に、以下の表Bにリストされる除草剤B.1 ~ B.202、とりわけ除草剤B.1 ~ B.201である:

30

【0445】

40

50

【表 5】

表B:

	除草剤B
B.1	クレトジム(clethodim)
B.2	クロジナホップ-プロバルギル(clodinafop-propargyl)
B.3	シクロキシジム(cycloxydim)
B.4	シハロホップ-ブチル(cyhalofop-butyl)
B.5	フェノキサプロップ-エチル(fenoxaprop-ethyl)
B.6	フェノキサプロップ-P-エチル(fenoxaprop-P-ethyl)
B.7	メタミホップ(metamifop)
B.8	ピノキサデン(pinoxaden)
B.9	プロホキシジム(profoxydim)
B.10	セトキシジム(setoxydim)
B.11	テプラロキシジム(tepraloxydime)
B.12	トラルコキシジム(tralkoxydim)
B.13	エスプロカルブ(esprocarb)
B.14	エトフメセート(ethofumesate)
B.15	モリネート(molinate)
B.16	プロスルホカルブ(prosulfocarb)
B.17	チオベンカルブ(thiobencarb)
B.18	トリアレート(triallate)
B.19	ベンスルフロン-メチル(bensulfuron-methyl)
B.20	ビスピリバック-ナトリウム(bispyribac-sodium)
B.21	クロランスラム-メチル(cloransulam-methyl)
B.22	クロルスルフロン(chlorsulfuron)
B.23	クロリムロン(clorimuron)
B.24	シクロスルファムロン(cyclosulfamuron)
B.25	ジクロスマム(diclosulam)
B.26	フロラスマム(florasulam)
B.27	フルメツラム(flumetsulam)
B.28	フルピルスルフロン-メチル-ナトリウム(flupyrifosulfuron-methyl-sodium)
B.29	ホラムスルフロン(foramsulfuron)
B.30	イマザモックス(imazamox)
B.31	イマザモックス-アンモニウム(imazamox-ammonium)
B.32	イマザピック(imazapic)
B.33	イマザピック-アンモニウム(imazapic-ammonium)
B.34	イマザピック-イソプロピルアンモニウム(imazapic-isopropylammonium)

	除草剤B
B.35	イマザビル(imazapyr)
B.36	イマザビル-アンモニウム(imazapyr-ammonium)
B.37	イマザビル-イソプロピルアンモニウム(imazapyr-isopropylammonium)
B.38	イマザキン(imazaquin)
B.39	イマザキン-アンモニウム(imazaquin-ammonium)
B.40	イマゼタビル(imazethapyr)
B.41	イマゼタビル-アンモニウム(imazethapyr-ammonium)
B.42	イマゼタビル-イソプロピルアンモニウム(imazethapyr-isopropylammonium)
B.43	イマゾスルフロン(imazosulfuron)
B.44	ヨードスルフロン-メチル-ナトリウム(iodosulfuron-methyl-sodium)
B.45	イオフェンスルフロン(iofensulfuron)
B.46	イオフェンスルフロン-ナトリウム(iofensulfuron-sodium)
B.47	メソスルフロン-メチル(mesosulfuron-methyl)
B.48	メタゾスルフロン(metazosulfuron)
B.49	メトスルフロン-メチル(metsulfuron-methyl)
B.50	メトスマム(metosulam)
B.51	ニコスルフロン(nicosulfuron)
B.52	ペノキスマム(Penoxyfural)
B.53	プロポキシカルバゾン-ナトリウム(propoxycarbazone-sodium)
B.54	ピラゾスルフロン-エチル(pyrazosulfuron-ethyl)
B.55	ピリベンソキシム(pyribenzoxim)
B.56	ピリフタリド(pyriflatalid)
B.57	ピロキスマム(pyroxysulam)
B.58	プロピリスルフロン(propyrisulfuron)
B.59	リムスルフロン(rimsulfuron)
B.60	スルホスルフロン(sulfosulfuron)
B.61	チエンカルバゾン-メチル(thiencarbazone-methyl)
B.62	チフェンスルフロン-メチル(thifensulfuron-methyl)
B.63	トリベニュロン-メチル(tribenuron-methyl)

10

20

30

40

50

除草剤B	
B.64	トリトルフロン(tritosulfuron)
B.65	トリアファモン(triafamone)
B.66	アメトリン(ametryne)
B.67	アトラジン(atrazine)
B.68	ベントゾン(bentazon)
B.69	ブロモキシニル(bromoxynil)
B.70	ブロモキシニル-オクタノエート(bromoxynil-octanoate)
B.71	ブロモキシニル-ヘプタノエート(bromoxynil-heptanoate)
B.72	ブロモキシニル-カリウム(bromoxynil-potassium)
B.73	ジウロン(diuron)
B.74	フルオメツロン(fluometuron)
B.75	ヘキサジノン(hexazinone)
B.76	イソプロツロン(isoproturon)
B.77	リニュロン(linuron)
B.78	メタミトロン(metamitron)
B.79	メトリブジン(metribuzin)
B.80	プロパニル(propanil)
B.81	シマジン(simazin)
B.82	テルブチラジン(terbutylazine)
B.83	テルブトリン(terbutryn)
B.84	パラコート-ジクロリド(paraquat-dichloride)
B.85	アシフルオルフエン(acifluorfen)
B.86	ブタフェナシル(butafenacil)
B.87	カルフェントラゾン-エチル(carfentrazone-ethyl)
B.88	フルミオキサジン(flumioxazin)
B.89	ホメサフエン(fomesafen)
B.90	オキサジアルギル(oxadiargyl)
B.91	オキシフルオルフエン(oxyfluorfen)
B.92	ピラフルフェン(pyraflufen)
B.93	ピラフルフェン-エチル(pyraflufen-ethyl)
B.94	サフルフェナシル(saflufenacil)
B.95	スルフェントラゾン(sulfentrazone)
B.96	トリフルジモキサジン(trifludimoxazin)
B.97	エチル[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]アセテート(CAS353292-31-6)
B.98	ベンゾビシクロン(benzobicyclon)
B.99	ビシクロピロン(bicyclopyprone)
B.100	クロマゾン(clomazone)

除草剤B	
B.101	ジフルフェニカン(diflufenican)
B.102	フルオロクロリドン(fluorochloridone)
B.103	イソキサフルトール(isoxaflutole)
B.104	メソトリオン(mesotrione)
B.105	ノルフルラゾン(norflurazone)
B.106	ピコリナフェン(picolinafen)
B.107	スルコトリオン(sulcotrione)
B.108	テフリルトリオン(tefuryltrione)
B.109	テンボトリオン(tembotrione)
B.110	トルピラレート(tolpyralate)
B.111	トプラメゾン(topramezone)
B.112	トプラメゾン-ナトリウム(topramezone-sodium)
B.113	アミトロール(amitrole)
B.114	フルオメツロン(fluometuron)
B.115	フェンキノトリオン(fenquintrione)
B.116	グリホサート(glyphosate)
B.117	グリホサート-アンモニウム(glyphosate-ammonium)
B.118	グリホサート-ジメチルアンモニウム(glyphosate-dimethylammonium)
B.119	グリホサート-イソプロピルアンモニウム(glyphosate-isopropylammonium)
B.120	グリホサート-トリメシウム(glyphosate-trimesium)(スルホサート(sulfosate))
B.121	グリホサート-カリウム(glyphosate-potassium)
B.122	グルホシネート(glufosinate)
B.123	グルホシネート-アンモニウム(glufosinate-ammonium)
B.124	グルホシネート-P(glufosinate-P)
B.125	グルホシネート-P-アンモニウム(glufosinate-P-ammonium)
B.126	ベンジメタリン(pendimethalin)
B.127	トリフルラリン(trifluralin)
B.128	アセトクロール(acetochlor)
B.129	ブタクロール(butachlor)
B.130	カフェンストロール(cafenstrole)
B.131	ジメテナミド-P(dimethenamid-P)
B.132	フェントラザミド(fentrazamide)
B.133	フルフェナセット(flufenacet)
B.134	メフェナセット(mefenacet)
B.135	メタザクロール(metaazachlor)
B.136	メトラクロール(metolachlor)
B.137	S-メトラクロール(S-metolachlor)

10

20

30

40

50

除草剤B	
B.138	プレチラクロール(pretilachlor)
B.139	フェノキサスルホン(fenoxyasulfone)
B.140	インダジフラム(indaziflam)
B.141	イソキサベン(isoxaben)
B.142	トリアジフラム(triaziflam)
B.143	イフエンカルバゾン(ipfencarbazone)
B.144	ピロキサスルホン(pyroxasulfone)
B.145	2,4-D
B.146	2,4-D-イソブチル
B.147	2,4-D-ジメチルアンモニウム
B.148	2,4-D-N,N,N-トリメチルエタノールアンモニウム
B.149	アミノピラリド(aminopyralid)
B.150	アミノピラリド-メチル(aminopyralid-methyl)
B.151	アミノピラリド-ジメチルアンモニウム(aminopyralid-dimethylammonium)
B.152	アミノピラミド-トリス(2-ヒドロキシプロピル)アンモニウム
B.153	クロピラリド(clopyralid)
B.154	クロピラリド-メチル(clopyralid-methyl)
B.155	クロピラリド-オラミン(clopyralid-olamine)
B.156	ジカンバ(dicamba)
B.157	ジカンバ-ブチル(dicamba-butotyl)
B.158	ジカンバ-ジグリコールアミン(dicamba-diglycolamine)
B.159	ジカンバ-ジメチルアンモニウム(dicamba-dimethylammonium)
B.160	ジカンバ-ジオラミン(dicamba-diolamine)
B.161	ジカンバ-イソプロピルアンモニウム(dicamba-isopropylammonium)
B.162	ジカンバ・カリウム(dicamba-potassium)
B.163	ジカンバナトリウム(dicamba-sodium)
B.164	ジカンバ-トロラミン(dicamba-trolamine)
B.165	ジカンバ-N,N-ビス-(3-アミノプロピル)メチルアミン
B.166	ジカンバ-ジエチレンetriアミン(dicamba-diethylenetriamine)
B.167	フルロキシピル(fluroxypyr)
B.168	フルロキシピル-メチル(fluroxypyr-methyl)

除草剤B	
B.169	ハロキシフェン(halauxifen)
B.170	ハロキシフェン-メチル(halauxifen-methyl)
B.171	MCPA
B.172	MCPA-2-エチルヘキシル
B.173	MCPA-ジメチルアンモニウム
B.174	キンクロラック(quinclorac)
B.175	キンクロラック-ジメチルアンモニウム(quinclorac-dimethylammonium)
B.176	キンメラック(quinmerac)
B.177	キンメラック-ジメチルアンモニウム(quinmerac-dimethylammonium)
B.178	フロピラウキシフェン (flopyrauxifen)
B.179	フロピラウキシフェン-ベンジル(CAS1390661-72-9)
B.180	アミノシクロピラクロール(aminocyclopyrachlor)
B.181	アミノシクロピラクロール-カリウム(aminocyclopyrachlor-potassium)
B.182	アミノシクロピラクロール-メチル(aminocyclopyrachlor-methyl)
B.183	ジフルフェンゾピル(diflufenzopyr)
B.184	ジフルフェンゾピル-ナトリウム(diflufenzopyr-sodium)
B.185	ジムロン(dymron)
B.186	インダノファン(indanofan)
B.187	オキサジクロメホン(oxaziclomefone)
B.188	II.1
B.189	II.2
B.190	II.3
B.191	II.4
B.192	II.5
B.193	II.6
B.194	II.7
B.195	II.8
B.196	II.9
B.197	4-アミノ-3-クロロ-5-フルオロ-6-(7-フルオロ-1H-インドール-6-イル)ピコリン酸(CAS 1629965-65-6)
B.198	フロピラウキシフェン (florpyrauxifen)
B.199	オキソトリオン (CAS 1486617-21-3)
B.200	シンメチリン(cinmethylin)

10

20

30

40

除草剤B	
B.201	2-クロロ-3-メチルスルファニル-N-(1-メチルテトラゾール-5-イル)-4-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(CAS 1361139-71-0)

除草剤B	
B.202	2-(2,4-ジクロロフェニル)メチル-4,4-ジメチル-3-イソオキサゾリドン(CAS 81777-95-9)

【0446】

さらに、式(I)のウラシルピリジンを薬害軽減剤と組み合わせて施用するのが有用なこと

50

がある。薬害軽減剤は、不要な植物に対する式(I)のウラシルピリジンの除草作用に大きな影響を与えることなく、有用植物に対する損傷を防止又は低減する化学化合物である。これらは、播種前(例えば、種子処理、苗条若しくは実生に)、又は有用植物の出芽前施用若しくは出芽後施用のいずれかで施用することができる。薬害軽減剤及び式(I)のウラシルピリジン、並びに場合により除草剤Bを同時に又は連続して施用することができる。

【0447】

本発明の別の実施形態において、本発明による組成物は、少なくとも1種の式(I)のウラシルピリジン及び少なくとも1種の薬害軽減剤C(成分C)を含む。

【0448】

好適な薬害軽減剤は、例えば、(キノリン-8-オキシ)酢酸、1-フェニル-5-ハロアルキル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-カルボン酸、1-フェニル-4,5-ジヒドロ-5-アルキル-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸、4,5-ジヒドロ-5,5-ジアリール-3-イソオキサゾールカルボン酸、ジクロロアセトアミド、アルファ-オキシイミノフェニルアセトニトリル、アセトフェノンオキシム、4,6-ジハロ-2-フェニルピリミジン、N-[[4-(アミノカルボニル)フェニル]スルホニル]-2-安息香酸アミド、1,8-ナフタル酸無水物、2-ハロ-4-(ハロアルキル)-5-チアゾールカルボン酸、ホスホルチオレート及びN-アルキル-O-フェニルカルバメート、並びにそれらの農業上許容可能な塩及びそれらの農業上許容可能な誘導体、例えばアミド、エステル及びチオエステル(但しこれらは酸基を有する)である。

【0449】

好ましい薬害軽減剤Cの例は、ベノキサコール(benoxacor)、クロキントセット(cloquintocet)、シオメトリニル(cyometrinil)、シプロスルファミド(cyprosulfamide)、ジクロルミド(dichlormid)、ジシクロノン(dicyclonon)、ジエトレート(dietholate)、フェンクロラゾール(fenchlorazole)、フェンクロリム(fenclorim)、フルラゾール(flurazole)、フルキソフェニム(fluxofenim)、フリラゾール(furilazole)、イソキサジフェン(isoxadifen)、メフェンピル(mefenpyr)、メフェナート(mephenate)、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、4-(ジクロロアセチル)-1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン(MON4660、CAS71526-07-3)、2,2,5-トリメチル-3-(ジクロロアセチル)-1,3-オキサゾリジン(R-29148、CAS52836-31-4)、メトカミフェン(metcamifen)及びBPCMS(CAS54091-06-4)である。とりわけ好ましいのは、ベノキサコール、クロキントセット、シオメトリニル、シプロスルファミド、ジクロルミド、ジシクロノン、ジエトレート、フェンクロラゾール、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン、メフェンピル、メフェナート、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、4-(ジクロロアセチル)-1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン(MON4660、CAS71526-07-3)、2,2,5-トリメチル-3-(ジクロロアセチル)-1,3-オキサゾリジン(R-29148、CAS52836-31-4)及びメトカミフェンである。

【0450】

本発明による組成物の構成成分である、成分Cとしての特に好ましい薬害軽減剤Cは、上記に定義される薬害軽減剤C;特に以下の表Cにリストされる薬害軽減剤C.1 ~ C.17である:

【0451】

10

20

30

40

50

【表6】

表C

薬害軽減剤C	
C.1	ベノキサコール(benoxacor)
C.2	クロキントセット(cloquintocet)
C.3	クロキントセット-メキシル(cloquintocet-mexyl)
C.4	シプロスルファミド(cyprosulfamide)
C.5	ジクロルミド(dichlormid)
C.6	フェンクロラゾール(fenchlorazole)
C.7	フェンクロラゾール・エチル(fenchlorazole-ethyl)
C.8	フェンクロリム(fenclorim)
C.9	フリラゾール(furilazole)
C.10	イソキサジフェン(isoxadifen)
C.11	イソキサジフェン-エチル(isoxadifen-ethyl)
C.12	メフェンピル(mefenpyr)
C.13	メフェンピル-ジエチル(mefenpyr-diethyl)
C.14	ナフタレン酸無水物(naphtalic acid anhydride)
C.15	4-(ジクロロアセチル)-1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン (CAS71526-07-3)
C.16	2,2,5-トリメチル-3-(ジクロロアセチル)-1,3-オキサゾリジン (CAS52836-31-4)
C.17	メトカミフェン(metcamifen)

10

20

30

【0452】

グループb1)~b15)の活性化合物B及び活性化合物Cは、公知の除草剤及び薬害軽減剤であり、例えばThe Compendium of Pesticide Common Names(<http://www.alanwood.net/pesticides/>);Farm Chemicals Handbook 2000年 86巻、Meister Publishing Company、2000年;B. Hock、C. Fedtke、R. R. Schmidt、Herbicide [Herbicides]、Georg Thieme Verlag、Stuttgart 1995年;W. H. Ahrens、Herbicide Handbook、第7版、Weed Science Society of America、1994年;及びK. K. Hatzios、Herbicide Handbook、第7版の追補、Weed Science Society of America、1998年を参照されたい。2,2,5-トリメチル-3-(ジクロロアセチル)-1,3-オキサゾリジン[CAS No. 52836-31-4]は、R-29148とも呼ばれる。4-(ジクロロアセチル)-1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン[CAS No. 71526-07-3]は、AD-67及びMON4660とも呼ばれる。

【0453】

活性化合物の各作用機序への割り当ては、現在の知識に基づいている。数種類の作用機序が1種類の活性化合物に当てはまる場合、その物質は、1種類の作用機序にのみ割り当てられた。

【0454】

本発明の好ましい実施形態によれば、本組成物は、除草活性化合物B又は成分Bとして、少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の除草剤Bを含む。

40

【0455】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、除草活性化合物B又は成分Bとして、少なくとも2種の、好ましくは正確に2種の互いに異なる除草剤Bを含む。

【0456】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、除草活性化合物B又は成分Bとして、少なくとも3種の、好ましくは正確に3種の互いに異なる除草剤Bを含む。

【0457】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、除草活性化合物B又は成分Bとして、少なくとも4種の、好ましくは正確に4種の互いに異なる除草剤Bを含む。

【0458】

50

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、薬害軽減成分C又は成分Cとして、少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の薬害軽減剤Cを含む。

【0459】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、成分Bとして少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の除草剤Bと、成分Cとして少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の薬害軽減剤Cを含む。

【0460】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、少なくとも2種の、好ましくは正確に2種の互いに異なる除草剤Bと、成分Cとして少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の薬害軽減剤Cを含む。

10

【0461】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、少なくとも3種の、好ましくは正確に3種の互いに異なる除草剤Bと、成分Cとして少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の薬害軽減剤Cを含む。

【0462】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、成分Aとして、少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の式(I)、好ましくは式(I.a)又は(I.h)の化合物、及び成分Bとして少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の除草剤Bを含む。

20

【0463】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、成分Aとして、少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の式(I)、好ましくは式(I.a)又は(I.h)の化合物、及び少なくとも2種の、好ましくは正確に2種の互いに異なる除草剤Bを含む。

【0464】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、成分Aとして、少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の式(I)、好ましくは式(I.a)又は(I.h)の化合物、及び少なくとも3種の、好ましくは正確に3種の互いに異なる除草剤Bを含む。

【0465】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、成分Aとして、少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の式(I)、好ましくは式(I.a)又は(I.h)の化合物、及び少なくとも4種の、好ましくは正確に4種の互いに異なる除草剤Bを含む。

30

【0466】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、成分Aとして、少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の式(I)、好ましくは式(I.a)又は(I.h)の化合物、及び成分Cとして少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の薬害軽減剤Cを含む。

【0467】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、成分Aとして、少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の式(I)、好ましくは式(I.a)又は(I.h)の化合物、成分Bとして少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の除草剤B、及び成分Cとして少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の薬害軽減剤Cを含む。

40

【0468】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、成分Aとして、少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の式(I)、好ましくは式(I.a)又は(I.h)の化合物、少なくとも2種の、好ましくは正確に2種の互いに異なる除草剤B、及び成分Cとして少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の薬害軽減剤Cを含む。

【0469】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、成分Aとして、少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の式(I)、好ましくは式(I.a)又は(I.h)の化合物、少なくとも3種の、好ましくは正確に3種の互いに異なる除草剤B、及び成分Cとして少なくとも1種の、好ましくは正確に1種の薬害軽減剤Cを含む。

【0470】

50

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、式(I)のウラシルピリジンに加えて、とりわけ、(I.a.87)、(I.a.109)、(I.a.115)、(I.a.255)、(I.a.277)、(I.a.283)、(I.a.339)、(I.a.361)、(I.a.367)、(I.h.87)、(I.h.109)、(I.h.115)、(I.h.255)、(I.h.277)、(I.h.283)、(I.h.339)、(I.h.361)及び(I.h.367)からなる群からの活性化合物、群b4)から、特にアシフルオルフェン、ブタフェンシル(butafencil)、カルフェネトラゾン-エチル(carfenetrazone-ethyl)、フルミオキサジン、ホメサフェン、オキサジアルギル、オキシフルオルフェン、ピラフルフェン、ピラフルフェン-エチル、サフルフェナシル、スルフェントラゾン、トリフルジモキサジン、エチル[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]アセテート(CAS353292-31-6)からなる群から選択される、少なくとも1種の、とりわけ正確に1種の除草活性化合物を含む。

【0471】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、式(I)のウラシルピリジンに加えて、とりわけ、(I.a.87)、(I.a.109)、(I.a.115)、(I.a.255)、(I.a.277)、(I.a.283)、(I.a.339)、(I.a.361)、(I.a.367)、(I.h.87)、(I.h.109)、(I.h.115)、(I.h.255)、(I.h.277)、(I.h.283)、(I.h.339)、(I.h.361)及び(I.h.367)からなる群からの活性化合物、群b6)から、特に、グリホサート、グリホサート-アンモニウム、グリホサート-ジメチルアンモニウム、グリホサート-イソプロピルアンモニウム及びグリホサート-トリメシウム(スルホサート)及びグリホサート-カリウムからなる群から選択される少なくとも1種の、とりわけ正確に1種の除草活性化合物を含む。

【0472】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、式(I)のウラシルピリジンに加えて、とりわけ、(I.a.87)、(I.a.109)、(I.a.115)、(I.a.255)、(I.a.277)、(I.a.283)、(I.a.339)、(I.a.361)、(I.a.367)、(I.h.87)、(I.h.109)、(I.h.115)、(I.h.255)、(I.h.277)、(I.h.283)、(I.h.339)、(I.h.361)及び(I.h.367)からなる群からの活性化合物、群b10)から選択される、特に、アセトクロール、ブタクロール、カafenストロール、ジメテナミド-P、フェントラザミド、フルフェナセット、メフェナセット、メタザクロール、メトラクロール、S-メトラクロール、フェノキサスルホン、イブフェンカルバゾン及びピロキサスルホンからなる群から選択される少なくとも1種の、とりわけ正確に1種の除草活性化合物を含む。同様に、好ましいのは、式(I)のウラシルピリジンに加えて、とりわけ、(I.a.87)、(I.a.109)、(I.a.115)、(I.a.255)、(I.a.277)、(I.a.283)、(I.a.339)、(I.a.361)、(I.a.367)、(I.h.87)、(I.h.109)、(I.h.115)、(I.h.255)、(I.h.277)、(I.h.283)、(I.h.339)、(I.h.361)及び(I.h.367)からなる群からの活性化合物、群b10)から、特に、上記に定義される式II.1、II.2、II.3、II.4、II.5、II.6、II.7、II.8及びII.9のイソオキサゾリン化合物からなる群から選択される、少なくとも1種の、とりわけ正確に1種の除草活性化合物を含む。

【0473】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、本組成物は、式(I)のウラシルピリジンに加えて、とりわけ、(I.a.87)、(I.a.109)、(I.a.115)、(I.a.255)、(I.a.277)、(I.a.283)、(I.a.339)、(I.a.361)、(I.a.367)、(I.h.87)、(I.h.109)、(I.h.115)、(I.h.255)、(I.h.277)、(I.h.283)、(I.h.339)、(I.h.361)及び(I.h.367)からなる群からの活性化合物、群b13)からの、特に、2,4-D、2,4-D-イソブチル、2,4-D-ジメチルアンモニウム、2,4-D-N、N,N-トリメチルエタノールアンモニウム、アミノシクロピラクロール、アミノシクロピラクロール-カリウム、アミノシクロピラクロール-メチル、アミノピラリド、アミノピラリド-メチル、アミノピラリド-ジメチルアンモニウム、アミノピラリド-トリス(2-ヒドロキシプロピル)アンモニウム、クロピラリド、クロピラリド-メチル、クロピラリド-オラミン、ジカンバ、ジカンバ-ブチル、ジカンバ-ジグリコールアミン、ジカンバ-ジメチルアンモニウム、ジカンバ-ジオラミン、ジカンバ-イソプロピルアンモニウム、ジカンバ-カリウム、ジカンバ-ナトリウム、ジカンバ-トロラミン、ジカンバ-N,N-ビス-(3-アミノプロピル)メチルアミン、ジカンバ-ジエチレントリアミン、フロピラウキシフェン、フルロキシピ

10

20

30

40

50

ル、フルロキシピル-メチル、ハラウキシフェン、ハラウキシフェン-メチル、MCPA、MCPA-2-エチルヘキシル、MCPA-ジメチルアンモニウム、キンクロラック、キンクロラック-ジメチルアンモニウム、キンメラック、キンメラック-ジメチルアンモニウム、フルピラウキシフェン、フルピラウキシフェン-ベンジル(CAS1390661-72-9)及び4-アミノ-3-クロロ-5-フルオロ-6-(7-フルオロ-1H-インドール-6-イル)ピコリン酸からなる群から選択される、少なくとも1種の、とりわけ正確に1種の除草活性化合物を含む。

【0474】

明細書中及び以下で、用語「二成分組成物」は、1種以上の、例えば1、2又は3種の式(I)の活性化合物と、1種以上の、例えば1、2若しくは3種の除草剤B又は1種以上の薬害軽減剤Cのいずれかとを含む組成物を包含する。

10

【0475】

同様に、用語「三成分組成物」は、1種以上の、例えば1、2又は3種の式(I)の活性化合物、1種以上の、例えば1、2又は3種の除草剤B及び1種以上の、例えば1、2又は3種の薬害軽減剤Cを含む組成物を包含する。

【0476】

成分Aとしての少なくとも1種の式(I)の化合物と少なくとも1種の除草剤Bとを含む二成分組成物において、活性化合物A:Bの重量比は、一般的に、1:1000～1000:1の範囲内、好ましくは1:500～500:1の範囲内、特に1:250～250:1の範囲内、特に好ましくは1:125～125:1の範囲内である。

20

【0477】

成分Aとしての少なくとも1種の式(I)の化合物と少なくとも1種の薬害軽減剤Cとを含む二成分組成物において、活性化合物A:Cの重量比は、一般的に、1:1000～1000:1の範囲内、好ましくは1:500～500:1の範囲内、特に1:250～250:1の範囲内、特に好ましくは1:125～125:1の範囲内である。

【0478】

成分Aとしての少なくとも1種の式(I)のウラシルピリジン、少なくとも1種の除草剤B及び少なくとも1種の薬害軽減剤Cを含む三成分組成物において、成分A:Bの相対重量比は、一般的に、1:1000～1000:1の範囲内、好ましくは1:500～500:1の範囲内、特に1:250～250:1の範囲内、特に好ましくは1:125～125:1の範囲内であり、成分A:Cの重量比は、一般的に、1:1000～1000:1の範囲内、好ましくは1:500～500:1の範囲内、特に1:250～250:1の範囲内、特に好ましくは1:75～75:1の範囲内であり、成分B:Cの重量比は、一般的に、1:1000～1000:1の範囲内、好ましくは1:500～500:1の範囲内、特に1:250～250:1の範囲内、特に好ましくは1:75～75:1の範囲内である。成分A+Bと成分Cとの重量比は、好ましくは1:500～500:1の範囲内、特に1:250～250:1の範囲内、特に好ましくは1:75～75:1の範囲内である。

30

【0479】

下記の好ましい混合物中の個々の成分の重量比は、本明細書において示される制限の範囲内、特に好ましい制限の範囲内である。

【0480】

特に好ましいのは、定義される式(I)のウラシルピリジンと表1の各列に定義される物質(1種又は複数種)とを含む下記の組成物;

40

とりわけ好ましいのは、唯一の除草活性化合物として、定義される式(I)のウラシルピリジンと表1の各列に定義される物質(1種又は複数種)とを含む下記の組成物;

最も好ましいのは、唯一の活性化合物として、定義される式(I)のウラシルピリジンと表1の各列に定義される物質(1種又は複数種)とを含む下記の組成物である。

【0481】

特に好ましいのは、ウラシルピリジン(Ia.339)と表1の各列に定義される物質(1種又は複数種)とを含む組成物1.1～1.3653、とりわけ組成物1.1～1.3635である:

【0482】

50

【表 7】

表1 (組成物1.1~1.3635):

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.1	B.1	--
1.2	B.2	--
1.3	B.3	--
1.4	B.4	--
1.5	B.5	--
1.6	B.6	--
1.7	B.7	--
1.8	B.8	--
1.9	B.9	--
1.10	B.10	--
1.11	B.11	--
1.12	B.12	--
1.13	B.13	--
1.14	B.14	--
1.15	B.15	--
1.16	B.16	--
1.17	B.17	--
1.18	B.18	--
1.19	B.19	--
1.20	B.20	--
1.21	B.21	--
1.22	B.22	--
1.23	B.23	--
1.24	B.24	--
1.25	B.25	--
1.26	B.26	--
1.27	B.27	--
1.28	B.28	--
1.29	B.29	--
1.30	B.30	--
1.31	B.31	--
1.32	B.32	--
1.33	B.33	--
1.34	B.34	--
1.35	B.35	--
1.36	B.36	--
1.37	B.37	--
1.38	B.38	--
1.39	B.39	--
1.40	B.40	--
1.41	B.41	--
1.42	B.42	--
1.43	B.43	--
1.44	B.44	--
1.45	B.45	--
1.46	B.46	--

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.47	B.47	--
1.48	B.48	--
1.49	B.49	--
1.50	B.50	--
1.51	B.51	--
1.52	B.52	--
1.53	B.53	--
1.54	B.54	--
1.55	B.55	--
1.56	B.56	--
1.57	B.57	--
1.58	B.58	--
1.59	B.59	--
1.60	B.60	--
1.61	B.61	--
1.62	B.62	--
1.63	B.63	--
1.64	B.64	--
1.65	B.65	--
1.66	B.66	--
1.67	B.67	--
1.68	B.68	--
1.69	B.69	--
1.70	B.70	--
1.71	B.71	--
1.72	B.72	--
1.73	B.73	--
1.74	B.74	--
1.75	B.75	--
1.76	B.76	--
1.77	B.77	--
1.78	B.78	--
1.79	B.79	--
1.80	B.80	--
1.81	B.81	--
1.82	B.82	--
1.83	B.83	--
1.84	B.84	--
1.85	B.85	--
1.86	B.86	--
1.87	B.87	--
1.88	B.88	--
1.89	B.89	--
1.90	B.90	--
1.91	B.91	--
1.92	B.92	--

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.93	B.93	--
1.94	B.94	--
1.95	B.95	--
1.96	B.96	--
1.97	B.97	--
1.98	B.98	--
1.99	B.99	--
1.100	B.100	--
1.101	B.101	--
1.102	B.102	--
1.103	B.103	--
1.104	B.104	--
1.105	B.105	--
1.106	B.106	--
1.107	B.107	--
1.108	B.108	--
1.109	B.109	--
1.110	B.110	--
1.111	B.111	--
1.112	B.112	--
1.113	B.113	--
1.114	B.114	--
1.115	B.115	--
1.116	B.116	--
1.117	B.117	--
1.118	B.118	--
1.119	B.119	--
1.120	B.120	--
1.121	B.121	--
1.122	B.122	--
1.123	B.123	--
1.124	B.124	--
1.125	B.125	--
1.126	B.126	--
1.127	B.127	--
1.128	B.128	--
1.129	B.129	--
1.130	B.130	--
1.131	B.131	--
1.132	B.132	--
1.133	B.133	--
1.134	B.134	--
1.135	B.135	--
1.136	B.136	--
1.137	B.137	--
1.138	B.138	--

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.139	B.139	--
1.140	B.140	--
1.141	B.141	--
1.142	B.142	--
1.143	B.143	--
1.144	B.144	--
1.145	B.145	--
1.146	B.146	--
1.147	B.147	--
1.148	B.148	--
1.149	B.149	--
1.150	B.150	--
1.151	B.151	--
1.152	B.152	--
1.153	B.153	--
1.154	B.154	--
1.155	B.155	--
1.156	B.156	--
1.157	B.157	--
1.158	B.158	--
1.159	B.159	--
1.160	B.160	--
1.161	B.161	--
1.162	B.162	--
1.163	B.163	--
1.164	B.164	--
1.165	B.165	--
1.166	B.166	--
1.167	B.167	--
1.168	B.168	--
1.169	B.169	--
1.170	B.170	--
1.171	B.171	--
1.172	B.172	--
1.173	B.173	--
1.174	B.174	--
1.175	B.175	--
1.176	B.176	--
1.177	B.177	--
1.178	B.178	--
1.179	B.179	--
1.180	B.180	--
1.181	B.181	--
1.182	B.182	--
1.183	B.183	--
1.184	B.184	--
1.185	B.185	--
1.186	B.186	--
1.187	B.187	--

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.188	B.188	--
1.189	B.189	--
1.190	B.190	--
1.191	B.191	--
1.192	B.192	--
1.193	B.193	--
1.194	B.194	--
1.195	B.195	--
1.196	B.196	--
1.197	B.197	--
1.198	B.198	--
1.199	B.199	--
1.200	B.200	--
1.201	B.201	--
1.202	B.1	C.1
1.203	B.2	C.1
1.204	B.3	C.1
1.205	B.4	C.1
1.206	B.5	C.1
1.207	B.6	C.1
1.208	B.7	C.1
1.209	B.8	C.1
1.210	B.9	C.1
1.211	B.10	C.1
1.212	B.11	C.1
1.213	B.12	C.1
1.214	B.13	C.1
1.215	B.14	C.1
1.216	B.15	C.1
1.217	B.16	C.1
1.218	B.17	C.1
1.219	B.18	C.1
1.220	B.19	C.1
1.221	B.20	C.1
1.222	B.21	C.1
1.223	B.22	C.1
1.224	B.23	C.1
1.225	B.24	C.1
1.226	B.25	C.1
1.227	B.26	C.1
1.228	B.27	C.1
1.229	B.28	C.1
1.230	B.29	C.1
1.231	B.30	C.1
1.232	B.31	C.1
1.233	B.32	C.1
1.234	B.33	C.1
1.235	B.34	C.1
1.236	B.35	C.1

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.237	B.36	C.1
1.238	B.37	C.1
1.239	B.38	C.1
1.240	B.39	C.1
1.241	B.40	C.1
1.242	B.41	C.1
1.243	B.42	C.1
1.244	B.43	C.1
1.245	B.44	C.1
1.246	B.45	C.1
1.247	B.46	C.1
1.248	B.47	C.1
1.249	B.48	C.1
1.250	B.49	C.1
1.251	B.50	C.1
1.252	B.51	C.1
1.253	B.52	C.1
1.254	B.53	C.1
1.255	B.54	C.1
1.256	B.55	C.1
1.257	B.56	C.1
1.258	B.57	C.1
1.259	B.58.	C.1
1.260	B.59	C.1
1.261	B.60	C.1
1.262	B.61	C.1
1.263	B.62	C.1
1.264	B.63	C.1
1.265	B.64	C.1
1.266	B.65	C.1
1.267	B.66	C.1
1.268	B.67	C.1
1.269	B.68	C.1
1.270	B.69	C.1
1.271	B.70	C.1
1.272	B.71	C.1
1.273	B.72	C.1
1.274	B.73	C.1
1.275	B.74	C.1
1.276	B.75	C.1
1.277	B.76	C.1
1.278	B.77	C.1
1.279	B.78	C.1
1.280	B.79	C.1
1.281	B.80	C.1
1.282	B.81	C.1
1.283	B.82	C.1
1.284	B.83	C.1
1.285	B.84	C.1

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.286	B.85	C.1
1.287	B.86	C.1
1.288	B.87	C.1
1.289	B.88	C.1
1.290	B.89	C.1
1.291	B.90	C.1
1.292	B.91	C.1
1.293	B.92	C.1
1.294	B.93	C.1
1.295	B.94	C.1
1.296	B.95	C.1
1.297	B.96	C.1
1.298	B.97	C.1
1.299	B.98	C.1
1.300	B.99	C.1
1.301	B.100	C.1
1.302	B.101	C.1
1.303	B.102	C.1
1.304	B.103	C.1
1.305	B.104	C.1
1.306	B.105	C.1
1.307	B.106	C.1
1.308	B.107	C.1
1.309	B.108	C.1
1.310	B.109	C.1
1.311	B.110	C.1
1.312	B.111	C.1
1.313	B.112	C.1
1.314	B.113	C.1
1.315	B.114	C.1
1.316	B.115	C.1
1.317	B.116	C.1
1.318	B.117	C.1
1.319	B.118	C.1
1.320	B.119	C.1
1.321	B.120	C.1
1.322	B.121	C.1
1.323	B.122	C.1
1.324	B.123	C.1
1.325	B.124	C.1
1.326	B.125	C.1
1.327	B.126	C.1
1.328	B.127	C.1
1.329	B.128	C.1
1.330	B.129	C.1
1.331	B.130	C.1
1.332	B.131	C.1
1.333	B.132	C.1
1.334	B.133	C.1

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.335	B.134	C.1
1.336	B.135	C.1
1.337	B.136	C.1
1.338	B.137	C.1
1.339	B.138	C.1
1.340	B.139	C.1
1.341	B.140	C.1
1.342	B.141	C.1
1.343	B.142	C.1
1.344	B.143	C.1
1.345	B.144	C.1
1.346	B.145	C.1
1.347	B.146	C.1
1.348	B.147	C.1
1.349	B.148	C.1
1.350	B.149	C.1
1.351	B.150	C.1
1.352	B.151	C.1
1.353	B.152	C.1
1.354	B.153	C.1
1.355	B.154	C.1
1.356	B.155	C.1
1.357	B.156	C.1
1.358	B.157	C.1
1.359	B.158	C.1
1.360	B.159	C.1
1.361	B.160	C.1
1.362	B.161	C.1
1.363	B.162	C.1
1.364	B.163	C.1
1.365	B.164	C.1
1.366	B.165	C.1
1.367	B.166	C.1
1.368	B.167	C.1
1.369	B.168	C.1
1.370	B.169	C.1
1.371	B.170	C.1
1.372	B.171	C.1
1.373	B.172	C.1
1.374	B.173	C.1
1.375	B.174	C.1
1.376	B.175	C.1
1.377	B.176	C.1
1.378	B.177	C.1
1.379	B.178	C.1
1.380	B.179	C.1
1.381	B.180	C.1
1.382	B.181	C.1
1.383	B.182	C.1

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.384	B.183	C.1
1.385	B.184	C.1
1.386	B.185	C.1
1.387	B.186	C.1
1.388	B.187	C.1
1.389	B.188	C.1
1.390	B.189	C.1
1.391	B.190	C.1
1.392	B.191	C.1
1.393	B.192	C.1
1.394	B.193	C.1
1.395	B.194	C.1
1.396	B.195	C.1
1.397	B.196	C.1
1.398	B.197	C.1
1.399	B.198	C.1
1.400	B.199	C.1
1.401	B.200	C.1
1.402	B.201	C.1
1.403	B.1	C.2
1.404	B.2	C.2
1.405	B.3	C.2
1.406	B.4	C.2
1.407	B.5	C.2
1.408	B.6	C.2
1.409	B.7	C.2
1.410	B.8	C.2
1.411	B.9	C.2
1.412	B.10	C.2
1.413	B.11	C.2
1.414	B.12	C.2
1.415	B.13	C.2
1.416	B.14	C.2
1.417	B.15	C.2
1.418	B.16	C.2
1.419	B.17	C.2
1.420	B.18	C.2
1.421	B.19	C.2
1.422	B.20	C.2
1.423	B.21	C.2
1.424	B.22	C.2
1.425	B.23	C.2
1.426	B.24	C.2
1.427	B.25	C.2
1.428	B.26	C.2
1.429	B.27	C.2
1.430	B.28	C.2
1.431	B.29	C.2
1.432	B.30	C.2

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.433	B.31	C.2
1.434	B.32	C.2
1.435	B.33	C.2
1.436	B.34	C.2
1.437	B.35	C.2
1.438	B.36	C.2
1.439	B.37	C.2
1.440	B.38	C.2
1.441	B.39	C.2
1.442	B.40	C.2
1.443	B.41	C.2
1.444	B.42	C.2
1.445	B.43	C.2
1.446	B.44	C.2
1.447	B.45	C.2
1.448	B.46	C.2
1.449	B.47	C.2
1.450	B.48	C.2
1.451	B.49	C.2
1.452	B.50	C.2
1.453	B.51	C.2
1.454	B.52	C.2
1.455	B.53	C.2
1.456	B.54	C.2
1.457	B.55	C.2
1.458	B.56	C.2
1.459	B.57	C.2
1.460	B.58.	C.2
1.461	B.59	C.2
1.462	B.60	C.2
1.463	B.61	C.2
1.464	B.62	C.2
1.465	B.63	C.2
1.466	B.64	C.2
1.467	B.65	C.2
1.468	B.66	C.2
1.469	B.67	C.2
1.470	B.68	C.2
1.471	B.69	C.2
1.472	B.70	C.2
1.473	B.71	C.2
1.474	B.72	C.2
1.475	B.73	C.2
1.476	B.74	C.2
1.477	B.75	C.2
1.478	B.76	C.2
1.479	B.77	C.2
1.480	B.78	C.2
1.481	B.79	C.2

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.482	B.80	C.2
1.483	B.81	C.2
1.484	B.82	C.2
1.485	B.83	C.2
1.486	B.84	C.2
1.487	B.85	C.2
1.488	B.86	C.2
1.489	B.87	C.2
1.490	B.88	C.2
1.491	B.89	C.2
1.492	B.90	C.2
1.493	B.91	C.2
1.494	B.92	C.2
1.495	B.93	C.2
1.496	B.94	C.2
1.497	B.95	C.2
1.498	B.96	C.2
1.499	B.97	C.2
1.500	B.98	C.2
1.501	B.99	C.2
1.502	B.100	C.2
1.503	B.101	C.2
1.504	B.102	C.2
1.505	B.103	C.2
1.506	B.104	C.2
1.507	B.105	C.2
1.508	B.106	C.2
1.509	B.107	C.2
1.510	B.108	C.2
1.511	B.109	C.2
1.512	B.110	C.2
1.513	B.111	C.2
1.514	B.112	C.2
1.515	B.113	C.2
1.516	B.114	C.2
1.517	B.115	C.2
1.518	B.116	C.2
1.519	B.117	C.2
1.520	B.118	C.2
1.521	B.119	C.2
1.522	B.120	C.2
1.523	B.121	C.2
1.524	B.122	C.2
1.525	B.123	C.2
1.526	B.124	C.2
1.527	B.125	C.2
1.528	B.126	C.2
1.529	B.127	C.2
1.530	B.128	C.2

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.531	B.129	C.2
1.532	B.130	C.2
1.533	B.131	C.2
1.534	B.132	C.2
1.535	B.133	C.2
1.536	B.134	C.2
1.537	B.135	C.2
1.538	B.136	C.2
1.539	B.137	C.2
1.540	B.138	C.2
1.541	B.139	C.2
1.542	B.140	C.2
1.543	B.141	C.2
1.544	B.142	C.2
1.545	B.143	C.2
1.546	B.144	C.2
1.547	B.145	C.2
1.548	B.146	C.2
1.549	B.147	C.2
1.550	B.148	C.2
1.551	B.149	C.2
1.552	B.150	C.2
1.553	B.151	C.2
1.554	B.152	C.2
1.555	B.153	C.2
1.556	B.154	C.2
1.557	B.155	C.2
1.558	B.156	C.2
1.559	B.157	C.2
1.560	B.158	C.2
1.561	B.159	C.2
1.562	B.160	C.2
1.563	B.161	C.2
1.564	B.162	C.2
1.565	B.163	C.2
1.566	B.164	C.2
1.567	B.165	C.2
1.568	B.166	C.2
1.569	B.167	C.2
1.570	B.168	C.2
1.571	B.169	C.2
1.572	B.170	C.2
1.573	B.171	C.2
1.574	B.172	C.2
1.575	B.173	C.2
1.576	B.174	C.2
1.577	B.175	C.2
1.578	B.176	C.2
1.579	B.177	C.2

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.580	B.178	C.2
1.581	B.179	C.2
1.582	B.180	C.2
1.583	B.181	C.2
1.584	B.182	C.2
1.585	B.183	C.2
1.586	B.184	C.2
1.587	B.185	C.2
1.588	B.186	C.2
1.589	B.187	C.2
1.590	B.188	C.2
1.591	B.189	C.2
1.592	B.190	C.2
1.593	B.191	C.2
1.594	B.192	C.2
1.595	B.193	C.2
1.596	B.194	C.2
1.597	B.195	C.2
1.598	B.196	C.2
1.599	B.197	C.2
1.600	B.198	C.2
1.601	B.199	C.2
1.602	B.200	C.2
1.603	B.201	C.2
1.604	B.1	C.3
1.605	B.2	C.3
1.606	B.3	C.3
1.607	B.4	C.3
1.608	B.5	C.3
1.609	B.6	C.3
1.610	B.7	C.3
1.611	B.8	C.3
1.612	B.9	C.3
1.613	B.10	C.3
1.614	B.11	C.3
1.615	B.12	C.3
1.616	B.13	C.3
1.617	B.14	C.3
1.618	B.15	C.3
1.619	B.16	C.3
1.620	B.17	C.3
1.621	B.18	C.3
1.622	B.19	C.3
1.623	B.20	C.3
1.624	B.21	C.3
1.625	B.22	C.3
1.626	B.23	C.3
1.627	B.24	C.3
1.628	B.25	C.3

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.629	B.26	C.3
1.630	B.27	C.3
1.631	B.28	C.3
1.632	B.29	C.3
1.633	B.30	C.3
1.634	B.31	C.3
1.635	B.32	C.3
1.636	B.33	C.3
1.637	B.34	C.3
1.638	B.35	C.3
1.639	B.36	C.3
1.640	B.37	C.3
1.641	B.38	C.3
1.642	B.39	C.3
1.643	B.40	C.3
1.644	B.41	C.3
1.645	B.42	C.3
1.646	B.43	C.3
1.647	B.44	C.3
1.648	B.45	C.3
1.649	B.46	C.3
1.650	B.47	C.3
1.651	B.48	C.3
1.652	B.49	C.3
1.653	B.50	C.3
1.654	B.51	C.3
1.655	B.52	C.3
1.656	B.53	C.3
1.657	B.54	C.3
1.658	B.55	C.3
1.659	B.56	C.3
1.660	B.57	C.3
1.661	B.58	C.3
1.662	B.59	C.3
1.663	B.60	C.3
1.664	B.61	C.3
1.665	B.62	C.3
1.666	B.63	C.3
1.667	B.64	C.3
1.668	B.65	C.3
1.669	B.66	C.3
1.670	B.67	C.3
1.671	B.68	C.3
1.672	B.69	C.3
1.673	B.70	C.3
1.674	B.71	C.3
1.675	B.72	C.3
1.676	B.73	C.3
1.677	B.74	C.3

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.678	B.75	C.3
1.679	B.76	C.3
1.680	B.77	C.3
1.681	B.78	C.3
1.682	B.79	C.3
1.683	B.80	C.3
1.684	B.81	C.3
1.685	B.82	C.3
1.686	B.83	C.3
1.687	B.84	C.3
1.688	B.85	C.3
1.689	B.86	C.3
1.690	B.87	C.3
1.691	B.88	C.3
1.692	B.89	C.3
1.693	B.90	C.3
1.694	B.91	C.3
1.695	B.92	C.3
1.696	B.93	C.3
1.697	B.94	C.3
1.698	B.95	C.3
1.699	B.96	C.3
1.700	B.97	C.3
1.701	B.98	C.3
1.702	B.99	C.3
1.703	B.100	C.3
1.704	B.101	C.3
1.705	B.102	C.3
1.706	B.103	C.3
1.707	B.104	C.3
1.708	B.105	C.3
1.709	B.106	C.3
1.710	B.107	C.3
1.711	B.108	C.3
1.712	B.109	C.3
1.713	B.110	C.3
1.714	B.111	C.3
1.715	B.112	C.3
1.716	B.113	C.3
1.717	B.114	C.3
1.718	B.115	C.3
1.719	B.116	C.3
1.720	B.117	C.3
1.721	B.118	C.3
1.722	B.119	C.3
1.723	B.120	C.3
1.724	B.121	C.3
1.725	B.122	C.3
1.726	B.123	C.3

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.727	B.124	C.3
1.728	B.125	C.3
1.729	B.126	C.3
1.730	B.127	C.3
1.731	B.128	C.3
1.732	B.129	C.3
1.733	B.130	C.3
1.734	B.131	C.3
1.735	B.132	C.3
1.736	B.133	C.3
1.737	B.134	C.3
1.738	B.135	C.3
1.739	B.136	C.3
1.740	B.137	C.3
1.741	B.138	C.3
1.742	B.139	C.3
1.743	B.140	C.3
1.744	B.141	C.3
1.745	B.142	C.3
1.746	B.143	C.3
1.747	B.144	C.3
1.748	B.145	C.3
1.749	B.146	C.3
1.750	B.147	C.3
1.751	B.148	C.3
1.752	B.149	C.3
1.753	B.150	C.3
1.754	B.151	C.3
1.755	B.152	C.3
1.756	B.153	C.3
1.757	B.154	C.3
1.758	B.155	C.3
1.759	B.156	C.3
1.760	B.157	C.3
1.761	B.158	C.3
1.762	B.159	C.3
1.763	B.160	C.3
1.764	B.161	C.3
1.765	B.162	C.3
1.766	B.163	C.3
1.767	B.164	C.3
1.768	B.165	C.3
1.769	B.166	C.3
1.770	B.167	C.3
1.771	B.168	C.3
1.772	B.169	C.3
1.773	B.170	C.3
1.774	B.171	C.3
1.775	B.172	C.3

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.776	B.173	C.3
1.777	B.174	C.3
1.778	B.175	C.3
1.779	B.176	C.3
1.780	B.177	C.3
1.781	B.178	C.3
1.782	B.179	C.3
1.783	B.180	C.3
1.784	B.181	C.3
1.785	B.182	C.3
1.786	B.183	C.3
1.787	B.184	C.3
1.788	B.185	C.3
1.789	B.186	C.3
1.790	B.187	C.3
1.791	B.188	C.3
1.792	B.189	C.3
1.793	B.190	C.3
1.794	B.191	C.3
1.795	B.192	C.3
1.796	B.193	C.3
1.797	B.194	C.3
1.798	B.195	C.3
1.799	B.196	C.3
1.800	B.197	C.3
1.801	B.198	C.3
1.802	B.199	C.3
1.803	B.200	C.3
1.804	B.201	C.3
1.805	B.1	C.4
1.806	B.2	C.4
1.807	B.3	C.4
1.808	B.4	C.4
1.809	B.5	C.4
1.810	B.6	C.4
1.811	B.7	C.4
1.812	B.8	C.4
1.813	B.9	C.4
1.814	B.10	C.4
1.815	B.11	C.4
1.816	B.12	C.4
1.817	B.13	C.4
1.818	B.14	C.4
1.819	B.15	C.4
1.820	B.16	C.4
1.821	B.17	C.4
1.822	B.18	C.4
1.823	B.19	C.4
1.824	B.20	C.4

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.825	B.21	C.4
1.826	B.22	C.4
1.827	B.23	C.4
1.828	B.24	C.4
1.829	B.25	C.4
1.830	B.26	C.4
1.831	B.27	C.4
1.832	B.28	C.4
1.833	B.29	C.4
1.834	B.30	C.4
1.835	B.31	C.4
1.836	B.32	C.4
1.837	B.33	C.4
1.838	B.34	C.4
1.839	B.35	C.4
1.840	B.36	C.4
1.841	B.37	C.4
1.842	B.38	C.4
1.843	B.39	C.4
1.844	B.40	C.4
1.845	B.41	C.4
1.846	B.42	C.4
1.847	B.43	C.4
1.848	B.44	C.4
1.849	B.45	C.4
1.850	B.46	C.4
1.851	B.47	C.4
1.852	B.48	C.4
1.853	B.49	C.4
1.854	B.50	C.4
1.855	B.51	C.4
1.856	B.52	C.4
1.857	B.53	C.4
1.858	B.54	C.4
1.859	B.55	C.4
1.860	B.56	C.4
1.861	B.57	C.4
1.862	B.58.	C.4
1.863	B.59	C.4
1.864	B.60	C.4
1.865	B.61	C.4
1.866	B.62	C.4
1.867	B.63	C.4
1.868	B.64	C.4
1.869	B.65	C.4
1.870	B.66	C.4
1.871	B.67	C.4
1.872	B.68	C.4
1.873	B.69	C.4

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.874	B.70	C.4
1.875	B.71	C.4
1.876	B.72	C.4
1.877	B.73	C.4
1.878	B.74	C.4
1.879	B.75	C.4
1.880	B.76	C.4
1.881	B.77	C.4
1.882	B.78	C.4
1.883	B.79	C.4
1.884	B.80	C.4
1.885	B.81	C.4
1.886	B.82	C.4
1.887	B.83	C.4
1.888	B.84	C.4
1.889	B.85	C.4
1.890	B.86	C.4
1.891	B.87	C.4
1.892	B.88	C.4
1.893	B.89	C.4
1.894	B.90	C.4
1.895	B.91	C.4
1.896	B.92	C.4
1.897	B.93	C.4
1.898	B.94	C.4
1.899	B.95	C.4
1.900	B.96	C.4
1.901	B.97	C.4
1.902	B.98	C.4
1.903	B.99	C.4
1.904	B.100	C.4
1.905	B.101	C.4
1.906	B.102	C.4
1.907	B.103	C.4
1.908	B.104	C.4
1.909	B.105	C.4
1.910	B.106	C.4
1.911	B.107	C.4
1.912	B.108	C.4
1.913	B.109	C.4
1.914	B.110	C.4
1.915	B.111	C.4
1.916	B.112	C.4
1.917	B.113	C.4
1.918	B.114	C.4
1.919	B.115	C.4
1.920	B.116	C.4
1.921	B.117	C.4
1.922	B.118	C.4

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.923	B.119	C.4
1.924	B.120	C.4
1.925	B.121	C.4
1.926	B.122	C.4
1.927	B.123	C.4
1.928	B.124	C.4
1.929	B.125	C.4
1.930	B.126	C.4
1.931	B.127	C.4
1.932	B.128	C.4
1.933	B.129	C.4
1.934	B.130	C.4
1.935	B.131	C.4
1.936	B.132	C.4
1.937	B.133	C.4
1.938	B.134	C.4
1.939	B.135	C.4
1.940	B.136	C.4
1.941	B.137	C.4
1.942	B.138	C.4
1.943	B.139	C.4
1.944	B.140	C.4
1.945	B.141	C.4
1.946	B.142	C.4
1.947	B.143	C.4
1.948	B.144	C.4
1.949	B.145	C.4
1.950	B.146	C.4
1.951	B.147	C.4
1.952	B.148	C.4
1.953	B.149	C.4
1.954	B.150	C.4
1.955	B.151	C.4
1.956	B.152	C.4
1.957	B.153	C.4
1.958	B.154	C.4
1.959	B.155	C.4
1.960	B.156	C.4
1.961	B.157	C.4
1.962	B.158	C.4
1.963	B.159	C.4
1.964	B.160	C.4
1.965	B.161	C.4
1.966	B.162	C.4
1.967	B.163	C.4
1.968	B.164	C.4
1.969	B.165	C.4
1.970	B.166	C.4
1.971	B.167	C.4

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.972	B.168	C.4
1.973	B.169	C.4
1.974	B.170	C.4
1.975	B.171	C.4
1.976	B.172	C.4
1.977	B.173	C.4
1.978	B.174	C.4
1.979	B.175	C.4
1.980	B.176	C.4
1.981	B.177	C.4
1.982	B.178	C.4
1.983	B.179	C.4
1.984	B.180	C.4
1.985	B.181	C.4
1.986	B.182	C.4
1.987	B.183	C.4
1.988	B.184	C.4
1.989	B.185	C.4
1.990	B.186	C.4
1.991	B.187	C.4
1.992	B.188	C.4
1.993	B.189	C.4
1.994	B.190	C.4
1.995	B.191	C.4
1.996	B.192	C.4
1.997	B.193	C.4
1.998	B.194	C.4
1.999	B.195	C.4
1.1000	B.196	C.4
1.1001	B.197	C.4
1.1002	B.198	C.4
1.1003	B.199	C.4
1.1004	B.200	C.4
1.1005	B.201	C.4
1.1006	B.1	C.5
1.1007	B.2	C.5
1.1008	B.3	C.5
1.1009	B.4	C.5
1.1010	B.5	C.5
1.1011	B.6	C.5
1.1012	B.7	C.5
1.1013	B.8	C.5
1.1014	B.9	C.5
1.1015	B.10	C.5
1.1016	B.11	C.5
1.1017	B.12	C.5
1.1018	B.13	C.5
1.1019	B.14	C.5
1.1020	B.15	C.5

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.1021	B.16	C.5
1.1022	B.17	C.5
1.1023	B.18	C.5
1.1024	B.19	C.5
1.1025	B.20	C.5
1.1026	B.21	C.5
1.1027	B.22	C.5
1.1028	B.23	C.5
1.1029	B.24	C.5
1.1030	B.25	C.5
1.1031	B.26	C.5
1.1032	B.27	C.5
1.1033	B.28	C.5
1.1034	B.29	C.5
1.1035	B.30	C.5
1.1036	B.31	C.5
1.1037	B.32	C.5
1.1038	B.33	C.5
1.1039	B.34	C.5
1.1040	B.35	C.5
1.1041	B.36	C.5
1.1042	B.37	C.5
1.1043	B.38	C.5
1.1044	B.39	C.5
1.1045	B.40	C.5
1.1046	B.41	C.5
1.1047	B.42	C.5
1.1048	B.43	C.5
1.1049	B.44	C.5
1.1050	B.45	C.5
1.1051	B.46	C.5
1.1052	B.47	C.5
1.1053	B.48	C.5
1.1054	B.49	C.5
1.1055	B.50	C.5
1.1056	B.51	C.5
1.1057	B.52	C.5
1.1058	B.53	C.5
1.1059	B.54	C.5
1.1060	B.55	C.5
1.1061	B.56	C.5
1.1062	B.57	C.5
1.1063	B.58.	C.5
1.1064	B.59	C.5
1.1065	B.60	C.5
1.1066	B.61	C.5
1.1067	B.62	C.5
1.1068	B.63	C.5
1.1069	B.64	C.5

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.1070	B.65	C.5
1.1071	B.66	C.5
1.1072	B.67	C.5
1.1073	B.68	C.5
1.1074	B.69	C.5
1.1075	B.70	C.5
1.1076	B.71	C.5
1.1077	B.72	C.5
1.1078	B.73	C.5
1.1079	B.74	C.5
1.1080	B.75	C.5
1.1081	B.76	C.5
1.1082	B.77	C.5
1.1083	B.78	C.5
1.1084	B.79	C.5
1.1085	B.80	C.5
1.1086	B.81	C.5
1.1087	B.82	C.5
1.1088	B.83	C.5
1.1089	B.84	C.5
1.1090	B.85	C.5
1.1091	B.86	C.5
1.1092	B.87	C.5
1.1093	B.88	C.5
1.1094	B.89	C.5
1.1095	B.90	C.5
1.1096	B.91	C.5
1.1097	B.92	C.5
1.1098	B.93	C.5
1.1099	B.94	C.5
1.1100	B.95	C.5
1.1101	B.96	C.5
1.1102	B.97	C.5
1.1103	B.98	C.5
1.1104	B.99	C.5
1.1105	B.100	C.5
1.1106	B.101	C.5
1.1107	B.102	C.5
1.1108	B.103	C.5
1.1109	B.104	C.5
1.1110	B.105	C.5
1.1111	B.106	C.5
1.1112	B.107	C.5
1.1113	B.108	C.5
1.1114	B.109	C.5
1.1115	B.110	C.5
1.1116	B.111	C.5
1.1117	B.112	C.5
1.1118	B.113	C.5

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.1119	B.114	C.5
1.1120	B.115	C.5
1.1121	B.116	C.5
1.1122	B.117	C.5
1.1123	B.118	C.5
1.1124	B.119	C.5
1.1125	B.120	C.5
1.1126	B.121	C.5
1.1127	B.122	C.5
1.1128	B.123	C.5
1.1129	B.124	C.5
1.1130	B.125	C.5
1.1131	B.126	C.5
1.1132	B.127	C.5
1.1133	B.128	C.5
1.1134	B.129	C.5
1.1135	B.130	C.5
1.1136	B.131	C.5
1.1137	B.132	C.5
1.1138	B.133	C.5
1.1139	B.134	C.5
1.1140	B.135	C.5
1.1141	B.136	C.5
1.1142	B.137	C.5
1.1143	B.138	C.5
1.1144	B.139	C.5
1.1145	B.140	C.5
1.1146	B.141	C.5
1.1147	B.142	C.5
1.1148	B.143	C.5
1.1149	B.144	C.5
1.1150	B.145	C.5
1.1151	B.146	C.5
1.1152	B.147	C.5
1.1153	B.148	C.5
1.1154	B.149	C.5
1.1155	B.150	C.5
1.1156	B.151	C.5
1.1157	B.152	C.5
1.1158	B.153	C.5
1.1159	B.154	C.5
1.1160	B.155	C.5
1.1161	B.156	C.5
1.1162	B.157	C.5
1.1163	B.158	C.5
1.1164	B.159	C.5
1.1165	B.160	C.5
1.1166	B.161	C.5
1.1167	B.162	C.5

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.1168	B.163	C.5
1.1169	B.164	C.5
1.1170	B.165	C.5
1.1171	B.166	C.5
1.1172	B.167	C.5
1.1173	B.168	C.5
1.1174	B.169	C.5
1.1175	B.170	C.5
1.1176	B.171	C.5
1.1177	B.172	C.5
1.1178	B.173	C.5
1.1179	B.174	C.5
1.1180	B.175	C.5
1.1181	B.176	C.5
1.1182	B.177	C.5
1.1183	B.178	C.5
1.1184	B.179	C.5
1.1185	B.180	C.5
1.1186	B.181	C.5
1.1187	B.182	C.5
1.1188	B.183	C.5
1.1189	B.184	C.5
1.1190	B.185	C.5
1.1191	B.186	C.5
1.1192	B.187	C.5
1.1193	B.188	C.5
1.1194	B.189	C.5
1.1195	B.190	C.5
1.1196	B.191	C.5
1.1197	B.192	C.5
1.1198	B.193	C.5
1.1199	B.194	C.5
1.1200	B.195	C.5
1.1201	B.196	C.5
1.1202	B.197	C.5
1.1203	B.198	C.5
1.1204	B.199	C.5
1.1205	B.200	C.5
1.1206	B.201	C.5
1.1207	B.1	C.6
1.1208	B.2	C.6
1.1209	B.3	C.6
1.1210	B.4	C.6
1.1211	B.5	C.6
1.1212	B.6	C.6
1.1213	B.7	C.6
1.1214	B.8	C.6
1.1215	B.9	C.6
1.1216	B.10	C.6

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.1217	B.11	C.6
1.1218	B.12	C.6
1.1219	B.13	C.6
1.1220	B.14	C.6
1.1221	B.15	C.6
1.1222	B.16	C.6
1.1223	B.17	C.6
1.1224	B.18	C.6
1.1225	B.19	C.6
1.1226	B.20	C.6
1.1227	B.21	C.6
1.1228	B.22	C.6
1.1229	B.23	C.6
1.1230	B.24	C.6
1.1231	B.25	C.6
1.1232	B.26	C.6
1.1233	B.27	C.6
1.1234	B.28	C.6
1.1235	B.29	C.6
1.1236	B.30	C.6
1.1237	B.31	C.6
1.1238	B.32	C.6
1.1239	B.33	C.6
1.1240	B.34	C.6
1.1241	B.35	C.6
1.1242	B.36	C.6
1.1243	B.37	C.6
1.1244	B.38	C.6
1.1245	B.39	C.6
1.1246	B.40	C.6
1.1247	B.41	C.6
1.1248	B.42	C.6
1.1249	B.43	C.6
1.1250	B.44	C.6
1.1251	B.45	C.6
1.1252	B.46	C.6
1.1253	B.47	C.6
1.1254	B.48	C.6
1.1255	B.49	C.6
1.1256	B.50	C.6
1.1257	B.51	C.6
1.1258	B.52	C.6
1.1259	B.53	C.6
1.1260	B.54	C.6
1.1261	B.55	C.6
1.1262	B.56	C.6
1.1263	B.57	C.6
1.1264	B.58	C.6
1.1265	B.59	C.6

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.1266	B.60	C.6
1.1267	B.61	C.6
1.1268	B.62	C.6
1.1269	B.63	C.6
1.1270	B.64	C.6
1.1271	B.65	C.6
1.1272	B.66	C.6
1.1273	B.67	C.6
1.1274	B.68	C.6
1.1275	B.69	C.6
1.1276	B.70	C.6
1.1277	B.71	C.6
1.1278	B.72	C.6
1.1279	B.73	C.6
1.1280	B.74	C.6
1.1281	B.75	C.6
1.1282	B.76	C.6
1.1283	B.77	C.6
1.1284	B.78	C.6
1.1285	B.79	C.6
1.1286	B.80	C.6
1.1287	B.81	C.6
1.1288	B.82	C.6
1.1289	B.83	C.6
1.1290	B.84	C.6
1.1291	B.85	C.6
1.1292	B.86	C.6
1.1293	B.87	C.6
1.1294	B.88	C.6
1.1295	B.89	C.6
1.1296	B.90	C.6
1.1297	B.91	C.6
1.1298	B.92	C.6
1.1299	B.93	C.6
1.1300	B.94	C.6
1.1301	B.95	C.6
1.1302	B.96	C.6
1.1303	B.97	C.6
1.1304	B.98	C.6
1.1305	B.99	C.6
1.1306	B.100	C.6
1.1307	B.101	C.6
1.1308	B.102	C.6
1.1309	B.103	C.6
1.1310	B.104	C.6
1.1311	B.105	C.6
1.1312	B.106	C.6
1.1313	B.107	C.6
1.1314	B.108	C.6

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.1315	B.109	C.6
1.1316	B.110	C.6
1.1317	B.111	C.6
1.1318	B.112	C.6
1.1319	B.113	C.6
1.1320	B.114	C.6
1.1321	B.115	C.6
1.1322	B.116	C.6
1.1323	B.117	C.6
1.1324	B.118	C.6
1.1325	B.119	C.6
1.1326	B.120	C.6
1.1327	B.121	C.6
1.1328	B.122	C.6
1.1329	B.123	C.6
1.1330	B.124	C.6
1.1331	B.125	C.6
1.1332	B.126	C.6
1.1333	B.127	C.6
1.1334	B.128	C.6
1.1335	B.129	C.6
1.1336	B.130	C.6
1.1337	B.131	C.6
1.1338	B.132	C.6
1.1339	B.133	C.6
1.1340	B.134	C.6
1.1341	B.135	C.6
1.1342	B.136	C.6
1.1343	B.137	C.6
1.1344	B.138	C.6
1.1345	B.139	C.6
1.1346	B.140	C.6
1.1347	B.141	C.6
1.1348	B.142	C.6
1.1349	B.143	C.6
1.1350	B.144	C.6
1.1351	B.145	C.6
1.1352	B.146	C.6
1.1353	B.147	C.6
1.1354	B.148	C.6
1.1355	B.149	C.6
1.1356	B.150	C.6
1.1357	B.151	C.6
1.1358	B.152	C.6
1.1359	B.153	C.6
1.1360	B.154	C.6
1.1361	B.155	C.6
1.1362	B.156	C.6
1.1363	B.157	C.6

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.1364	B.158	C.6
1.1365	B.159	C.6
1.1366	B.160	C.6
1.1367	B.161	C.6
1.1368	B.162	C.6
1.1369	B.163	C.6
1.1370	B.164	C.6
1.1371	B.165	C.6
1.1372	B.166	C.6
1.1373	B.167	C.6
1.1374	B.168	C.6
1.1375	B.169	C.6
1.1376	B.170	C.6
1.1377	B.171	C.6
1.1378	B.172	C.6
1.1379	B.173	C.6
1.1380	B.174	C.6
1.1381	B.175	C.6
1.1382	B.176	C.6
1.1383	B.177	C.6
1.1384	B.178	C.6
1.1385	B.179	C.6
1.1386	B.180	C.6
1.1387	B.181	C.6
1.1388	B.182	C.6
1.1389	B.183	C.6
1.1390	B.184	C.6
1.1391	B.185	C.6
1.1392	B.186	C.6
1.1393	B.187	C.6
1.1394	B.188	C.6
1.1395	B.189	C.6
1.1396	B.190	C.6
1.1397	B.191	C.6
1.1398	B.192	C.6
1.1399	B.193	C.6
1.1400	B.194	C.6
1.1401	B.195	C.6
1.1402	B.196	C.6
1.1403	B.197	C.6
1.1404	B.198	C.6
1.1405	B.199	C.6
1.1406	B.200	C.6
1.1407	B.201	C.6
1.1408	B.1	C.7
1.1409	B.2	C.7
1.1410	B.3	C.7
1.1411	B.4	C.7
1.1412	B.5	C.7

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.1413	B.6	C.7
1.1414	B.7	C.7
1.1415	B.8	C.7
1.1416	B.9	C.7
1.1417	B.10	C.7
1.1418	B.11	C.7
1.1419	B.12	C.7
1.1420	B.13	C.7
1.1421	B.14	C.7
1.1422	B.15	C.7
1.1423	B.16	C.7
1.1424	B.17	C.7
1.1425	B.18	C.7
1.1426	B.19	C.7
1.1427	B.20	C.7
1.1428	B.21	C.7
1.1429	B.22	C.7
1.1430	B.23	C.7
1.1431	B.24	C.7
1.1432	B.25	C.7
1.1433	B.26	C.7
1.1434	B.27	C.7
1.1435	B.28	C.7
1.1436	B.29	C.7
1.1437	B.30	C.7
1.1438	B.31	C.7
1.1439	B.32	C.7
1.1440	B.33	C.7
1.1441	B.34	C.7
1.1442	B.35	C.7
1.1443	B.36	C.7
1.1444	B.37	C.7
1.1445	B.38	C.7
1.1446	B.39	C.7
1.1447	B.40	C.7
1.1448	B.41	C.7
1.1449	B.42	C.7
1.1450	B.43	C.7
1.1451	B.44	C.7
1.1452	B.45	C.7
1.1453	B.46	C.7
1.1454	B.47	C.7
1.1455	B.48	C.7
1.1456	B.49	C.7
1.1457	B.50	C.7
1.1458	B.51	C.7
1.1459	B.52	C.7
1.1460	B.53	C.7
1.1461	B.54	C.7

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.1462	B.55	C.7
1.1463	B.56	C.7
1.1464	B.57	C.7
1.1465	B.58.	C.7
1.1466	B.59	C.7
1.1467	B.60	C.7
1.1468	B.61	C.7
1.1469	B.62	C.7
1.1470	B.63	C.7
1.1471	B.64	C.7
1.1472	B.65	C.7
1.1473	B.66	C.7
1.1474	B.67	C.7
1.1475	B.68	C.7
1.1476	B.69	C.7
1.1477	B.70	C.7
1.1478	B.71	C.7
1.1479	B.72	C.7
1.1480	B.73	C.7
1.1481	B.74	C.7
1.1482	B.75	C.7
1.1483	B.76	C.7
1.1484	B.77	C.7
1.1485	B.78	C.7
1.1486	B.79	C.7
1.1487	B.80	C.7
1.1488	B.81	C.7
1.1489	B.82	C.7
1.1490	B.83	C.7
1.1491	B.84	C.7
1.1492	B.85	C.7
1.1493	B.86	C.7
1.1494	B.87	C.7
1.1495	B.88	C.7
1.1496	B.89	C.7
1.1497	B.90	C.7
1.1498	B.91	C.7
1.1499	B.92	C.7
1.1500	B.93	C.7
1.1501	B.94	C.7
1.1502	B.95	C.7
1.1503	B.96	C.7
1.1504	B.97	C.7
1.1505	B.98	C.7
1.1506	B.99	C.7
1.1507	B.100	C.7
1.1508	B.101	C.7
1.1509	B.102	C.7
1.1510	B.103	C.7

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.1511	B.104	C.7
1.1512	B.105	C.7
1.1513	B.106	C.7
1.1514	B.107	C.7
1.1515	B.108	C.7
1.1516	B.109	C.7
1.1517	B.110	C.7
1.1518	B.111	C.7
1.1519	B.112	C.7
1.1520	B.113	C.7
1.1521	B.114	C.7
1.1522	B.115	C.7
1.1523	B.116	C.7
1.1524	B.117	C.7
1.1525	B.118	C.7
1.1526	B.119	C.7
1.1527	B.120	C.7
1.1528	B.121	C.7
1.1529	B.122	C.7
1.1530	B.123	C.7
1.1531	B.124	C.7
1.1532	B.125	C.7
1.1533	B.126	C.7
1.1534	B.127	C.7
1.1535	B.128	C.7
1.1536	B.129	C.7
1.1537	B.130	C.7
1.1538	B.131	C.7
1.1539	B.132	C.7
1.1540	B.133	C.7
1.1541	B.134	C.7
1.1542	B.135	C.7
1.1543	B.136	C.7
1.1544	B.137	C.7
1.1545	B.138	C.7
1.1546	B.139	C.7
1.1547	B.140	C.7
1.1548	B.141	C.7
1.1549	B.142	C.7
1.1550	B.143	C.7
1.1551	B.144	C.7
1.1552	B.145	C.7
1.1553	B.146	C.7
1.1554	B.147	C.7
1.1555	B.148	C.7
1.1556	B.149	C.7
1.1557	B.150	C.7
1.1558	B.151	C.7
1.1559	B.152	C.7

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.1560	B.153	C.7
1.1561	B.154	C.7
1.1562	B.155	C.7
1.1563	B.156	C.7
1.1564	B.157	C.7
1.1565	B.158	C.7
1.1566	B.159	C.7
1.1567	B.160	C.7
1.1568	B.161	C.7
1.1569	B.162	C.7
1.1570	B.163	C.7
1.1571	B.164	C.7
1.1572	B.165	C.7
1.1573	B.166	C.7
1.1574	B.167	C.7
1.1575	B.168	C.7
1.1576	B.169	C.7
1.1577	B.170	C.7
1.1578	B.171	C.7
1.1579	B.172	C.7
1.1580	B.173	C.7
1.1581	B.174	C.7
1.1582	B.175	C.7
1.1583	B.176	C.7
1.1584	B.177	C.7
1.1585	B.178	C.7
1.1586	B.179	C.7
1.1587	B.180	C.7
1.1588	B.181	C.7
1.1589	B.182	C.7
1.1590	B.183	C.7
1.1591	B.184	C.7
1.1592	B.185	C.7
1.1593	B.186	C.7
1.1594	B.187	C.7
1.1595	B.188	C.7
1.1596	B.189	C.7
1.1597	B.190	C.7
1.1598	B.191	C.7
1.1599	B.192	C.7
1.1600	B.193	C.7
1.1601	B.194	C.7
1.1602	B.195	C.7
1.1603	B.196	C.7
1.1604	B.197	C.7
1.1605	B.198	C.7
1.1606	B.199	C.7
1.1607	B.200	C.7
1.1608	B.201	C.7

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.1609	B.1	C.8
1.1610	B.2	C.8
1.1611	B.3	C.8
1.1612	B.4	C.8
1.1613	B.5	C.8
1.1614	B.6	C.8
1.1615	B.7	C.8
1.1616	B.8	C.8
1.1617	B.9	C.8
1.1618	B.10	C.8
1.1619	B.11	C.8
1.1620	B.12	C.8
1.1621	B.13	C.8
1.1622	B.14	C.8
1.1623	B.15	C.8
1.1624	B.16	C.8
1.1625	B.17	C.8
1.1626	B.18	C.8
1.1627	B.19	C.8
1.1628	B.20	C.8
1.1629	B.21	C.8
1.1630	B.22	C.8
1.1631	B.23	C.8
1.1632	B.24	C.8
1.1633	B.25	C.8
1.1634	B.26	C.8
1.1635	B.27	C.8
1.1636	B.28	C.8
1.1637	B.29	C.8
1.1638	B.30	C.8
1.1639	B.31	C.8
1.1640	B.32	C.8
1.1641	B.33	C.8
1.1642	B.34	C.8
1.1643	B.35	C.8
1.1644	B.36	C.8
1.1645	B.37	C.8
1.1646	B.38	C.8
1.1647	B.39	C.8
1.1648	B.40	C.8
1.1649	B.41	C.8
1.1650	B.42	C.8
1.1651	B.43	C.8
1.1652	B.44	C.8
1.1653	B.45	C.8
1.1654	B.46	C.8
1.1655	B.47	C.8
1.1656	B.48	C.8
1.1657	B.49	C.8

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.1658	B.50	C.8
1.1659	B.51	C.8
1.1660	B.52	C.8
1.1661	B.53	C.8
1.1662	B.54	C.8
1.1663	B.55	C.8
1.1664	B.56	C.8
1.1665	B.57	C.8
1.1666	B.58	C.8
1.1667	B.59	C.8
1.1668	B.60	C.8
1.1669	B.61	C.8
1.1670	B.62	C.8
1.1671	B.63	C.8
1.1672	B.64	C.8
1.1673	B.65	C.8
1.1674	B.66	C.8
1.1675	B.67	C.8
1.1676	B.68	C.8
1.1677	B.69	C.8
1.1678	B.70	C.8
1.1679	B.71	C.8
1.1680	B.72	C.8
1.1681	B.73	C.8
1.1682	B.74	C.8
1.1683	B.75	C.8
1.1684	B.76	C.8
1.1685	B.77	C.8
1.1686	B.78	C.8
1.1687	B.79	C.8
1.1688	B.80	C.8
1.1689	B.81	C.8
1.1690	B.82	C.8
1.1691	B.83	C.8
1.1692	B.84	C.8
1.1693	B.85	C.8
1.1694	B.86	C.8
1.1695	B.87	C.8
1.1696	B.88	C.8
1.1697	B.89	C.8
1.1698	B.90	C.8
1.1699	B.91	C.8
1.1700	B.92	C.8
1.1701	B.93	C.8
1.1702	B.94	C.8
1.1703	B.95	C.8
1.1704	B.96	C.8
1.1705	B.97	C.8
1.1706	B.98	C.8

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.1707	B.99	C.8
1.1708	B.100	C.8
1.1709	B.101	C.8
1.1710	B.102	C.8
1.1711	B.103	C.8
1.1712	B.104	C.8
1.1713	B.105	C.8
1.1714	B.106	C.8
1.1715	B.107	C.8
1.1716	B.108	C.8
1.1717	B.109	C.8
1.1718	B.110	C.8
1.1719	B.111	C.8
1.1720	B.112	C.8
1.1721	B.113	C.8
1.1722	B.114	C.8
1.1723	B.115	C.8
1.1724	B.116	C.8
1.1725	B.117	C.8
1.1726	B.118	C.8
1.1727	B.119	C.8
1.1728	B.120	C.8
1.1729	B.121	C.8
1.1730	B.122	C.8
1.1731	B.123	C.8
1.1732	B.124	C.8
1.1733	B.125	C.8
1.1734	B.126	C.8
1.1735	B.127	C.8
1.1736	B.128	C.8
1.1737	B.129	C.8
1.1738	B.130	C.8
1.1739	B.131	C.8
1.1740	B.132	C.8
1.1741	B.133	C.8
1.1742	B.134	C.8
1.1743	B.135	C.8
1.1744	B.136	C.8
1.1745	B.137	C.8
1.1746	B.138	C.8
1.1747	B.139	C.8
1.1748	B.140	C.8
1.1749	B.141	C.8
1.1750	B.142	C.8
1.1751	B.143	C.8
1.1752	B.144	C.8
1.1753	B.145	C.8
1.1754	B.146	C.8
1.1755	B.147	C.8

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.1756	B.148	C.8
1.1757	B.149	C.8
1.1758	B.150	C.8
1.1759	B.151	C.8
1.1760	B.152	C.8
1.1761	B.153	C.8
1.1762	B.154	C.8
1.1763	B.155	C.8
1.1764	B.156	C.8
1.1765	B.157	C.8
1.1766	B.158	C.8
1.1767	B.159	C.8
1.1768	B.160	C.8
1.1769	B.161	C.8
1.1770	B.162	C.8
1.1771	B.163	C.8
1.1772	B.164	C.8
1.1773	B.165	C.8
1.1774	B.166	C.8
1.1775	B.167	C.8
1.1776	B.168	C.8
1.1777	B.169	C.8
1.1778	B.170	C.8
1.1779	B.171	C.8
1.1780	B.172	C.8
1.1781	B.173	C.8
1.1782	B.174	C.8
1.1783	B.175	C.8
1.1784	B.176	C.8
1.1785	B.177	C.8
1.1786	B.178	C.8
1.1787	B.179	C.8
1.1788	B.180	C.8
1.1789	B.181	C.8
1.1790	B.182	C.8
1.1791	B.183	C.8
1.1792	B.184	C.8
1.1793	B.185	C.8
1.1794	B.186	C.8
1.1795	B.187	C.8
1.1796	B.188	C.8
1.1797	B.189	C.8
1.1798	B.190	C.8
1.1799	B.191	C.8
1.1800	B.192	C.8
1.1801	B.193	C.8
1.1802	B.194	C.8
1.1803	B.195	C.8
1.1804	B.196	C.8

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.1805	B.197	C.8
1.1806	B.198	C.8
1.1807	B.199	C.8
1.1808	B.200	C.8
1.1809	B.201	C.8
1.1810	B.1	C.9
1.1811	B.2	C.9
1.1812	B.3	C.9
1.1813	B.4	C.9
1.1814	B.5	C.9
1.1815	B.6	C.9
1.1816	B.7	C.9
1.1817	B.8	C.9
1.1818	B.9	C.9
1.1819	B.10	C.9
1.1820	B.11	C.9
1.1821	B.12	C.9
1.1822	B.13	C.9
1.1823	B.14	C.9
1.1824	B.15	C.9
1.1825	B.16	C.9
1.1826	B.17	C.9
1.1827	B.18	C.9
1.1828	B.19	C.9
1.1829	B.20	C.9
1.1830	B.21	C.9
1.1831	B.22	C.9
1.1832	B.23	C.9
1.1833	B.24	C.9
1.1834	B.25	C.9
1.1835	B.26	C.9
1.1836	B.27	C.9
1.1837	B.28	C.9
1.1838	B.29	C.9
1.1839	B.30	C.9
1.1840	B.31	C.9
1.1841	B.32	C.9
1.1842	B.33	C.9
1.1843	B.34	C.9
1.1844	B.35	C.9
1.1845	B.36	C.9
1.1846	B.37	C.9
1.1847	B.38	C.9
1.1848	B.39	C.9
1.1849	B.40	C.9
1.1850	B.41	C.9
1.1851	B.42	C.9
1.1852	B.43	C.9
1.1853	B.44	C.9

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.1854	B.45	C.9
1.1855	B.46	C.9
1.1856	B.47	C.9
1.1857	B.48	C.9
1.1858	B.49	C.9
1.1859	B.50	C.9
1.1860	B.51	C.9
1.1861	B.52	C.9
1.1862	B.53	C.9
1.1863	B.54	C.9
1.1864	B.55	C.9
1.1865	B.56	C.9
1.1866	B.57	C.9
1.1867	B.58.	C.9
1.1868	B.59	C.9
1.1869	B.60	C.9
1.1870	B.61	C.9
1.1871	B.62	C.9
1.1872	B.63	C.9
1.1873	B.64	C.9
1.1874	B.65	C.9
1.1875	B.66	C.9
1.1876	B.67	C.9
1.1877	B.68	C.9
1.1878	B.69	C.9
1.1879	B.70	C.9
1.1880	B.71	C.9
1.1881	B.72	C.9
1.1882	B.73	C.9
1.1883	B.74	C.9
1.1884	B.75	C.9
1.1885	B.76	C.9
1.1886	B.77	C.9
1.1887	B.78	C.9
1.1888	B.79	C.9
1.1889	B.80	C.9
1.1890	B.81	C.9
1.1891	B.82	C.9
1.1892	B.83	C.9
1.1893	B.84	C.9
1.1894	B.85	C.9
1.1895	B.86	C.9
1.1896	B.87	C.9
1.1897	B.88	C.9
1.1898	B.89	C.9
1.1899	B.90	C.9
1.1900	B.91	C.9
1.1901	B.92	C.9
1.1902	B.93	C.9

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.1903	B.94	C.9
1.1904	B.95	C.9
1.1905	B.96	C.9
1.1906	B.97	C.9
1.1907	B.98	C.9
1.1908	B.99	C.9
1.1909	B.100	C.9
1.1910	B.101	C.9
1.1911	B.102	C.9
1.1912	B.103	C.9
1.1913	B.104	C.9
1.1914	B.105	C.9
1.1915	B.106	C.9
1.1916	B.107	C.9
1.1917	B.108	C.9
1.1918	B.109	C.9
1.1919	B.110	C.9
1.1920	B.111	C.9
1.1921	B.112	C.9
1.1922	B.113	C.9
1.1923	B.114	C.9
1.1924	B.115	C.9
1.1925	B.116	C.9
1.1926	B.117	C.9
1.1927	B.118	C.9
1.1928	B.119	C.9
1.1929	B.120	C.9
1.1930	B.121	C.9
1.1931	B.122	C.9
1.1932	B.123	C.9
1.1933	B.124	C.9
1.1934	B.125	C.9
1.1935	B.126	C.9
1.1936	B.127	C.9
1.1937	B.128	C.9
1.1938	B.129	C.9
1.1939	B.130	C.9
1.1940	B.131	C.9
1.1941	B.132	C.9
1.1942	B.133	C.9
1.1943	B.134	C.9
1.1944	B.135	C.9
1.1945	B.136	C.9
1.1946	B.137	C.9
1.1947	B.138	C.9
1.1948	B.139	C.9
1.1949	B.140	C.9
1.1950	B.141	C.9
1.1951	B.142	C.9

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.1952	B.143	C.9
1.1953	B.144	C.9
1.1954	B.145	C.9
1.1955	B.146	C.9
1.1956	B.147	C.9
1.1957	B.148	C.9
1.1958	B.149	C.9
1.1959	B.150	C.9
1.1960	B.151	C.9
1.1961	B.152	C.9
1.1962	B.153	C.9
1.1963	B.154	C.9
1.1964	B.155	C.9
1.1965	B.156	C.9
1.1966	B.157	C.9
1.1967	B.158	C.9
1.1968	B.159	C.9
1.1969	B.160	C.9
1.1970	B.161	C.9
1.1971	B.162	C.9
1.1972	B.163	C.9
1.1973	B.164	C.9
1.1974	B.165	C.9
1.1975	B.166	C.9
1.1976	B.167	C.9
1.1977	B.168	C.9
1.1978	B.169	C.9
1.1979	B.170	C.9
1.1980	B.171	C.9
1.1981	B.172	C.9
1.1982	B.173	C.9
1.1983	B.174	C.9
1.1984	B.175	C.9
1.1985	B.176	C.9
1.1986	B.177	C.9
1.1987	B.178	C.9
1.1988	B.179	C.9
1.1989	B.180	C.9
1.1990	B.181	C.9
1.1991	B.182	C.9
1.1992	B.183	C.9
1.1993	B.184	C.9
1.1994	B.185	C.9
1.1995	B.186	C.9
1.1996	B.187	C.9
1.1997	B.188	C.9
1.1998	B.189	C.9
1.1999	B.190	C.9
1.2000	B.191	C.9

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.2001	B.192	C.9
1.2002	B.193	C.9
1.2003	B.194	C.9
1.2004	B.195	C.9
1.2005	B.196	C.9
1.2006	B.197	C.9
1.2007	B.198	C.9
1.2008	B.199	C.9
1.2009	B.200	C.9
1.2010	B.201	C.9
1.2011	B.1	C.10
1.2012	B.2	C.10
1.2013	B.3	C.10
1.2014	B.4	C.10
1.2015	B.5	C.10
1.2016	B.6	C.10
1.2017	B.7	C.10
1.2018	B.8	C.10
1.2019	B.9	C.10
1.2020	B.10	C.10
1.2021	B.11	C.10
1.2022	B.12	C.10
1.2023	B.13	C.10
1.2024	B.14	C.10
1.2025	B.15	C.10
1.2026	B.16	C.10
1.2027	B.17	C.10
1.2028	B.18	C.10
1.2029	B.19	C.10
1.2030	B.20	C.10
1.2031	B.21	C.10
1.2032	B.22	C.10
1.2033	B.23	C.10
1.2034	B.24	C.10
1.2035	B.25	C.10
1.2036	B.26	C.10
1.2037	B.27	C.10
1.2038	B.28	C.10
1.2039	B.29	C.10
1.2040	B.30	C.10
1.2041	B.31	C.10
1.2042	B.32	C.10
1.2043	B.33	C.10
1.2044	B.34	C.10
1.2045	B.35	C.10
1.2046	B.36	C.10
1.2047	B.37	C.10
1.2048	B.38	C.10
1.2049	B.39	C.10

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.2050	B.40	C.10
1.2051	B.41	C.10
1.2052	B.42	C.10
1.2053	B.43	C.10
1.2054	B.44	C.10
1.2055	B.45	C.10
1.2056	B.46	C.10
1.2057	B.47	C.10
1.2058	B.48	C.10
1.2059	B.49	C.10
1.2060	B.50	C.10
1.2061	B.51	C.10
1.2062	B.52	C.10
1.2063	B.53	C.10
1.2064	B.54	C.10
1.2065	B.55	C.10
1.2066	B.56	C.10
1.2067	B.57	C.10
1.2068	B.58.	C.10
1.2069	B.59	C.10
1.2070	B.60	C.10
1.2071	B.61	C.10
1.2072	B.62	C.10
1.2073	B.63	C.10
1.2074	B.64	C.10
1.2075	B.65	C.10
1.2076	B.66	C.10
1.2077	B.67	C.10
1.2078	B.68	C.10
1.2079	B.69	C.10
1.2080	B.70	C.10
1.2081	B.71	C.10
1.2082	B.72	C.10
1.2083	B.73	C.10
1.2084	B.74	C.10
1.2085	B.75	C.10
1.2086	B.76	C.10
1.2087	B.77	C.10
1.2088	B.78	C.10
1.2089	B.79	C.10
1.2090	B.80	C.10
1.2091	B.81	C.10
1.2092	B.82	C.10
1.2093	B.83	C.10
1.2094	B.84	C.10
1.2095	B.85	C.10
1.2096	B.86	C.10
1.2097	B.87	C.10
1.2098	B.88	C.10

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.2099	B.89	C.10
1.2100	B.90	C.10
1.2101	B.91	C.10
1.2102	B.92	C.10
1.2103	B.93	C.10
1.2104	B.94	C.10
1.2105	B.95	C.10
1.2106	B.96	C.10
1.2107	B.97	C.10
1.2108	B.98	C.10
1.2109	B.99	C.10
1.2110	B.100	C.10
1.2111	B.101	C.10
1.2112	B.102	C.10
1.2113	B.103	C.10
1.2114	B.104	C.10
1.2115	B.105	C.10
1.2116	B.106	C.10
1.2117	B.107	C.10
1.2118	B.108	C.10
1.2119	B.109	C.10
1.2120	B.110	C.10
1.2121	B.111	C.10
1.2122	B.112	C.10
1.2123	B.113	C.10
1.2124	B.114	C.10
1.2125	B.115	C.10
1.2126	B.116	C.10
1.2127	B.117	C.10
1.2128	B.118	C.10
1.2129	B.119	C.10
1.2130	B.120	C.10
1.2131	B.121	C.10
1.2132	B.122	C.10
1.2133	B.123	C.10
1.2134	B.124	C.10
1.2135	B.125	C.10
1.2136	B.126	C.10
1.2137	B.127	C.10
1.2138	B.128	C.10
1.2139	B.129	C.10
1.2140	B.130	C.10
1.2141	B.131	C.10
1.2142	B.132	C.10
1.2143	B.133	C.10
1.2144	B.134	C.10
1.2145	B.135	C.10
1.2146	B.136	C.10
1.2147	B.137	C.10

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.2148	B.138	C.10
1.2149	B.139	C.10
1.2150	B.140	C.10
1.2151	B.141	C.10
1.2152	B.142	C.10
1.2153	B.143	C.10
1.2154	B.144	C.10
1.2155	B.145	C.10
1.2156	B.146	C.10
1.2157	B.147	C.10
1.2158	B.148	C.10
1.2159	B.149	C.10
1.2160	B.150	C.10
1.2161	B.151	C.10
1.2162	B.152	C.10
1.2163	B.153	C.10
1.2164	B.154	C.10
1.2165	B.155	C.10
1.2166	B.156	C.10
1.2167	B.157	C.10
1.2168	B.158	C.10
1.2169	B.159	C.10
1.2170	B.160	C.10
1.2171	B.161	C.10
1.2172	B.162	C.10
1.2173	B.163	C.10
1.2174	B.164	C.10
1.2175	B.165	C.10
1.2176	B.166	C.10
1.2177	B.167	C.10
1.2178	B.168	C.10
1.2179	B.169	C.10
1.2180	B.170	C.10
1.2181	B.171	C.10
1.2182	B.172	C.10
1.2183	B.173	C.10
1.2184	B.174	C.10
1.2185	B.175	C.10
1.2186	B.176	C.10
1.2187	B.177	C.10
1.2188	B.178	C.10
1.2189	B.179	C.10
1.2190	B.180	C.10
1.2191	B.181	C.10
1.2192	B.182	C.10
1.2193	B.183	C.10
1.2194	B.184	C.10
1.2195	B.185	C.10
1.2196	B.186	C.10

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C	組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C	組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.2197	B.187	C.10	1.2246	B.35	C.11	1.2295	B.84	C.11
1.2198	B.188	C.10	1.2247	B.36	C.11	1.2296	B.85	C.11
1.2199	B.189	C.10	1.2248	B.37	C.11	1.2297	B.86	C.11
1.2200	B.190	C.10	1.2249	B.38	C.11	1.2298	B.87	C.11
1.2201	B.191	C.10	1.2250	B.39	C.11	1.2299	B.88	C.11
1.2202	B.192	C.10	1.2251	B.40	C.11	1.2300	B.89	C.11
1.2203	B.193	C.10	1.2252	B.41	C.11	1.2301	B.90	C.11
1.2204	B.194	C.10	1.2253	B.42	C.11	1.2302	B.91	C.11
1.2205	B.195	C.10	1.2254	B.43	C.11	1.2303	B.92	C.11
1.2206	B.196	C.10	1.2255	B.44	C.11	1.2304	B.93	C.11
1.2207	B.197	C.10	1.2256	B.45	C.11	1.2305	B.94	C.11
1.2208	B.198	C.10	1.2257	B.46	C.11	1.2306	B.95	C.11
1.2209	B.199	C.10	1.2258	B.47	C.11	1.2307	B.96	C.11
1.2210	B.200	C.10	1.2259	B.48	C.11	1.2308	B.97	C.11
1.2211	B.201	C.10	1.2260	B.49	C.11	1.2309	B.98	C.11
1.2212	B.1	C.11	1.2261	B.50	C.11	1.2310	B.99	C.11
1.2213	B.2	C.11	1.2262	B.51	C.11	1.2311	B.100	C.11
1.2214	B.3	C.11	1.2263	B.52	C.11	1.2312	B.101	C.11
1.2215	B.4	C.11	1.2264	B.53	C.11	1.2313	B.102	C.11
1.2216	B.5	C.11	1.2265	B.54	C.11	1.2314	B.103	C.11
1.2217	B.6	C.11	1.2266	B.55	C.11	1.2315	B.104	C.11
1.2218	B.7	C.11	1.2267	B.56	C.11	1.2316	B.105	C.11
1.2219	B.8	C.11	1.2268	B.57	C.11	1.2317	B.106	C.11
1.2220	B.9	C.11	1.2269	B.58	C.11	1.2318	B.107	C.11
1.2221	B.10	C.11	1.2270	B.59	C.11	1.2319	B.108	C.11
1.2222	B.11	C.11	1.2271	B.60	C.11	1.2320	B.109	C.11
1.2223	B.12	C.11	1.2272	B.61	C.11	1.2321	B.110	C.11
1.2224	B.13	C.11	1.2273	B.62	C.11	1.2322	B.111	C.11
1.2225	B.14	C.11	1.2274	B.63	C.11	1.2323	B.112	C.11
1.2226	B.15	C.11	1.2275	B.64	C.11	1.2324	B.113	C.11
1.2227	B.16	C.11	1.2276	B.65	C.11	1.2325	B.114	C.11
1.2228	B.17	C.11	1.2277	B.66	C.11	1.2326	B.115	C.11
1.2229	B.18	C.11	1.2278	B.67	C.11	1.2327	B.116	C.11
1.2230	B.19	C.11	1.2279	B.68	C.11	1.2328	B.117	C.11
1.2231	B.20	C.11	1.2280	B.69	C.11	1.2329	B.118	C.11
1.2232	B.21	C.11	1.2281	B.70	C.11	1.2330	B.119	C.11
1.2233	B.22	C.11	1.2282	B.71	C.11	1.2331	B.120	C.11
1.2234	B.23	C.11	1.2283	B.72	C.11	1.2332	B.121	C.11
1.2235	B.24	C.11	1.2284	B.73	C.11	1.2333	B.122	C.11
1.2236	B.25	C.11	1.2285	B.74	C.11	1.2334	B.123	C.11
1.2237	B.26	C.11	1.2286	B.75	C.11	1.2335	B.124	C.11
1.2238	B.27	C.11	1.2287	B.76	C.11	1.2336	B.125	C.11
1.2239	B.28	C.11	1.2288	B.77	C.11	1.2337	B.126	C.11
1.2240	B.29	C.11	1.2289	B.78	C.11	1.2338	B.127	C.11
1.2241	B.30	C.11	1.2290	B.79	C.11	1.2339	B.128	C.11
1.2242	B.31	C.11	1.2291	B.80	C.11	1.2340	B.129	C.11
1.2243	B.32	C.11	1.2292	B.81	C.11	1.2341	B.130	C.11
1.2244	B.33	C.11	1.2293	B.82	C.11	1.2342	B.131	C.11
1.2245	B.34	C.11	1.2294	B.83	C.11	1.2343	B.132	C.11

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C	組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C	組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.2344	B.133	C.11	1.2393	B.182	C.11	1.2442	B.30	C.12
1.2345	B.134	C.11	1.2394	B.183	C.11	1.2443	B.31	C.12
1.2346	B.135	C.11	1.2395	B.184	C.11	1.2444	B.32	C.12
1.2347	B.136	C.11	1.2396	B.185	C.11	1.2445	B.33	C.12
1.2348	B.137	C.11	1.2397	B.186	C.11	1.2446	B.34	C.12
1.2349	B.138	C.11	1.2398	B.187	C.11	1.2447	B.35	C.12
1.2350	B.139	C.11	1.2399	B.188	C.11	1.2448	B.36	C.12
1.2351	B.140	C.11	1.2400	B.189	C.11	1.2449	B.37	C.12
1.2352	B.141	C.11	1.2401	B.190	C.11	1.2450	B.38	C.12
1.2353	B.142	C.11	1.2402	B.191	C.11	1.2451	B.39	C.12
1.2354	B.143	C.11	1.2403	B.192	C.11	1.2452	B.40	C.12
1.2355	B.144	C.11	1.2404	B.193	C.11	1.2453	B.41	C.12
1.2356	B.145	C.11	1.2405	B.194	C.11	1.2454	B.42	C.12
1.2357	B.146	C.11	1.2406	B.195	C.11	1.2455	B.43	C.12
1.2358	B.147	C.11	1.2407	B.196	C.11	1.2456	B.44	C.12
1.2359	B.148	C.11	1.2408	B.197	C.11	1.2457	B.45	C.12
1.2360	B.149	C.11	1.2409	B.198	C.11	1.2458	B.46	C.12
1.2361	B.150	C.11	1.2410	B.199	C.11	1.2459	B.47	C.12
1.2362	B.151	C.11	1.2411	B.200	C.11	1.2460	B.48	C.12
1.2363	B.152	C.11	1.2412	B.201	C.11	1.2461	B.49	C.12
1.2364	B.153	C.11	1.2413	B.1	C.12	1.2462	B.50	C.12
1.2365	B.154	C.11	1.2414	B.2	C.12	1.2463	B.51	C.12
1.2366	B.155	C.11	1.2415	B.3	C.12	1.2464	B.52	C.12
1.2367	B.156	C.11	1.2416	B.4	C.12	1.2465	B.53	C.12
1.2368	B.157	C.11	1.2417	B.5	C.12	1.2466	B.54	C.12
1.2369	B.158	C.11	1.2418	B.6	C.12	1.2467	B.55	C.12
1.2370	B.159	C.11	1.2419	B.7	C.12	1.2468	B.56	C.12
1.2371	B.160	C.11	1.2420	B.8	C.12	1.2469	B.57	C.12
1.2372	B.161	C.11	1.2421	B.9	C.12	1.2470	B.58	C.12
1.2373	B.162	C.11	1.2422	B.10	C.12	1.2471	B.59	C.12
1.2374	B.163	C.11	1.2423	B.11	C.12	1.2472	B.60	C.12
1.2375	B.164	C.11	1.2424	B.12	C.12	1.2473	B.61	C.12
1.2376	B.165	C.11	1.2425	B.13	C.12	1.2474	B.62	C.12
1.2377	B.166	C.11	1.2426	B.14	C.12	1.2475	B.63	C.12
1.2378	B.167	C.11	1.2427	B.15	C.12	1.2476	B.64	C.12
1.2379	B.168	C.11	1.2428	B.16	C.12	1.2477	B.65	C.12
1.2380	B.169	C.11	1.2429	B.17	C.12	1.2478	B.66	C.12
1.2381	B.170	C.11	1.2430	B.18	C.12	1.2479	B.67	C.12
1.2382	B.171	C.11	1.2431	B.19	C.12	1.2480	B.68	C.12
1.2383	B.172	C.11	1.2432	B.20	C.12	1.2481	B.69	C.12
1.2384	B.173	C.11	1.2433	B.21	C.12	1.2482	B.70	C.12
1.2385	B.174	C.11	1.2434	B.22	C.12	1.2483	B.71	C.12
1.2386	B.175	C.11	1.2435	B.23	C.12	1.2484	B.72	C.12
1.2387	B.176	C.11	1.2436	B.24	C.12	1.2485	B.73	C.12
1.2388	B.177	C.11	1.2437	B.25	C.12	1.2486	B.74	C.12
1.2389	B.178	C.11	1.2438	B.26	C.12	1.2487	B.75	C.12
1.2390	B.179	C.11	1.2439	B.27	C.12	1.2488	B.76	C.12
1.2391	B.180	C.11	1.2440	B.28	C.12	1.2489	B.77	C.12
1.2392	B.181	C.11	1.2441	B.29	C.12	1.2490	B.78	C.12

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.2491	B.79	C.12
1.2492	B.80	C.12
1.2493	B.81	C.12
1.2494	B.82	C.12
1.2495	B.83	C.12
1.2496	B.84	C.12
1.2497	B.85	C.12
1.2498	B.86	C.12
1.2499	B.87	C.12
1.2500	B.88	C.12
1.2501	B.89	C.12
1.2502	B.90	C.12
1.2503	B.91	C.12
1.2504	B.92	C.12
1.2505	B.93	C.12
1.2506	B.94	C.12
1.2507	B.95	C.12
1.2508	B.96	C.12
1.2509	B.97	C.12
1.2510	B.98	C.12
1.2511	B.99	C.12
1.2512	B.100	C.12
1.2513	B.101	C.12
1.2514	B.102	C.12
1.2515	B.103	C.12
1.2516	B.104	C.12
1.2517	B.105	C.12
1.2518	B.106	C.12
1.2519	B.107	C.12
1.2520	B.108	C.12
1.2521	B.109	C.12
1.2522	B.110	C.12
1.2523	B.111	C.12
1.2524	B.112	C.12
1.2525	B.113	C.12
1.2526	B.114	C.12
1.2527	B.115	C.12
1.2528	B.116	C.12
1.2529	B.117	C.12
1.2530	B.118	C.12
1.2531	B.119	C.12
1.2532	B.120	C.12
1.2533	B.121	C.12
1.2534	B.122	C.12
1.2535	B.123	C.12
1.2536	B.124	C.12
1.2537	B.125	C.12
1.2538	B.126	C.12
1.2539	B.127	C.12

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.2540	B.128	C.12
1.2541	B.129	C.12
1.2542	B.130	C.12
1.2543	B.131	C.12
1.2544	B.132	C.12
1.2545	B.133	C.12
1.2546	B.134	C.12
1.2547	B.135	C.12
1.2548	B.136	C.12
1.2549	B.137	C.12
1.2550	B.138	C.12
1.2551	B.139	C.12
1.2552	B.140	C.12
1.2553	B.141	C.12
1.2554	B.142	C.12
1.2555	B.143	C.12
1.2556	B.144	C.12
1.2557	B.145	C.12
1.2558	B.146	C.12
1.2559	B.147	C.12
1.2560	B.148	C.12
1.2561	B.149	C.12
1.2562	B.150	C.12
1.2563	B.151	C.12
1.2564	B.152	C.12
1.2565	B.153	C.12
1.2566	B.154	C.12
1.2567	B.155	C.12
1.2568	B.156	C.12
1.2569	B.157	C.12
1.2570	B.158	C.12
1.2571	B.159	C.12
1.2572	B.160	C.12
1.2573	B.161	C.12
1.2574	B.162	C.12
1.2575	B.163	C.12
1.2576	B.164	C.12
1.2577	B.165	C.12
1.2578	B.166	C.12
1.2579	B.167	C.12
1.2580	B.168	C.12
1.2581	B.169	C.12
1.2582	B.170	C.12
1.2583	B.171	C.12
1.2584	B.172	C.12
1.2585	B.173	C.12
1.2586	B.174	C.12
1.2587	B.175	C.12
1.2588	B.176	C.12

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.2589	B.177	C.12
1.2590	B.178	C.12
1.2591	B.179	C.12
1.2592	B.180	C.12
1.2593	B.181	C.12
1.2594	B.182	C.12
1.2595	B.183	C.12
1.2596	B.184	C.12
1.2597	B.185	C.12
1.2598	B.186	C.12
1.2599	B.187	C.12
1.2600	B.188	C.12
1.2601	B.189	C.12
1.2602	B.190	C.12
1.2603	B.191	C.12
1.2604	B.192	C.12
1.2605	B.193	C.12
1.2606	B.194	C.12
1.2607	B.195	C.12
1.2608	B.196	C.12
1.2609	B.197	C.12
1.2610	B.198	C.12
1.2611	B.199	C.12
1.2612	B.200	C.12
1.2613	B.201	C.12
1.2614	B.1	C.13
1.2615	B.2	C.13
1.2616	B.3	C.13
1.2617	B.4	C.13
1.2618	B.5	C.13
1.2619	B.6	C.13
1.2620	B.7	C.13
1.2621	B.8	C.13
1.2622	B.9	C.13
1.2623	B.10	C.13
1.2624	B.11	C.13
1.2625	B.12	C.13
1.2626	B.13	C.13
1.2627	B.14	C.13
1.2628	B.15	C.13
1.2629	B.16	C.13
1.2630	B.17	C.13
1.2631	B.18	C.13
1.2632	B.19	C.13
1.2633	B.20	C.13
1.2634	B.21	C.13
1.2635	B.22	C.13
1.2636	B.23	C.13
1.2637	B.24	C.13

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.2638	B.25	C.13
1.2639	B.26	C.13
1.2640	B.27	C.13
1.2641	B.28	C.13
1.2642	B.29	C.13
1.2643	B.30	C.13
1.2644	B.31	C.13
1.2645	B.32	C.13
1.2646	B.33	C.13
1.2647	B.34	C.13
1.2648	B.35	C.13
1.2649	B.36	C.13
1.2650	B.37	C.13
1.2651	B.38	C.13
1.2652	B.39	C.13
1.2653	B.40	C.13
1.2654	B.41	C.13
1.2655	B.42	C.13
1.2656	B.43	C.13
1.2657	B.44	C.13
1.2658	B.45	C.13
1.2659	B.46	C.13
1.2660	B.47	C.13
1.2661	B.48	C.13
1.2662	B.49	C.13
1.2663	B.50	C.13
1.2664	B.51	C.13
1.2665	B.52	C.13
1.2666	B.53	C.13
1.2667	B.54	C.13
1.2668	B.55	C.13
1.2669	B.56	C.13
1.2670	B.57	C.13
1.2671	B.58.	C.13
1.2672	B.59	C.13
1.2673	B.60	C.13
1.2674	B.61	C.13
1.2675	B.62	C.13
1.2676	B.63	C.13
1.2677	B.64	C.13
1.2678	B.65	C.13
1.2679	B.66	C.13
1.2680	B.67	C.13
1.2681	B.68	C.13
1.2682	B.69	C.13
1.2683	B.70	C.13
1.2684	B.71	C.13
1.2685	B.72	C.13
1.2686	B.73	C.13

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.2687	B.74	C.13
1.2688	B.75	C.13
1.2689	B.76	C.13
1.2690	B.77	C.13
1.2691	B.78	C.13
1.2692	B.79	C.13
1.2693	B.80	C.13
1.2694	B.81	C.13
1.2695	B.82	C.13
1.2696	B.83	C.13
1.2697	B.84	C.13
1.2698	B.85	C.13
1.2699	B.86	C.13
1.2700	B.87	C.13
1.2701	B.88	C.13
1.2702	B.89	C.13
1.2703	B.90	C.13
1.2704	B.91	C.13
1.2705	B.92	C.13
1.2706	B.93	C.13
1.2707	B.94	C.13
1.2708	B.95	C.13
1.2709	B.96	C.13
1.2710	B.97	C.13
1.2711	B.98	C.13
1.2712	B.99	C.13
1.2713	B.100	C.13
1.2714	B.101	C.13
1.2715	B.102	C.13
1.2716	B.103	C.13
1.2717	B.104	C.13
1.2718	B.105	C.13
1.2719	B.106	C.13
1.2720	B.107	C.13
1.2721	B.108	C.13
1.2722	B.109	C.13
1.2723	B.110	C.13
1.2724	B.111	C.13
1.2725	B.112	C.13
1.2726	B.113	C.13
1.2727	B.114	C.13
1.2728	B.115	C.13
1.2729	B.116	C.13
1.2730	B.117	C.13
1.2731	B.118	C.13
1.2732	B.119	C.13
1.2733	B.120	C.13
1.2734	B.121	C.13
1.2735	B.122	C.13

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.2736	B.123	C.13
1.2737	B.124	C.13
1.2738	B.125	C.13
1.2739	B.126	C.13
1.2740	B.127	C.13
1.2741	B.128	C.13
1.2742	B.129	C.13
1.2743	B.130	C.13
1.2744	B.131	C.13
1.2745	B.132	C.13
1.2746	B.133	C.13
1.2747	B.134	C.13
1.2748	B.135	C.13
1.2749	B.136	C.13
1.2750	B.137	C.13
1.2751	B.138	C.13
1.2752	B.139	C.13
1.2753	B.140	C.13
1.2754	B.141	C.13
1.2755	B.142	C.13
1.2756	B.143	C.13
1.2757	B.144	C.13
1.2758	B.145	C.13
1.2759	B.146	C.13
1.2760	B.147	C.13
1.2761	B.148	C.13
1.2762	B.149	C.13
1.2763	B.150	C.13
1.2764	B.151	C.13
1.2765	B.152	C.13
1.2766	B.153	C.13
1.2767	B.154	C.13
1.2768	B.155	C.13
1.2769	B.156	C.13
1.2770	B.157	C.13
1.2771	B.158	C.13
1.2772	B.159	C.13
1.2773	B.160	C.13
1.2774	B.161	C.13
1.2775	B.162	C.13
1.2776	B.163	C.13
1.2777	B.164	C.13
1.2778	B.165	C.13
1.2779	B.166	C.13
1.2780	B.167	C.13
1.2781	B.168	C.13
1.2782	B.169	C.13
1.2783	B.170	C.13
1.2784	B.171	C.13

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.2785	B.172	C.13
1.2786	B.173	C.13
1.2787	B.174	C.13
1.2788	B.175	C.13
1.2789	B.176	C.13
1.2790	B.177	C.13
1.2791	B.178	C.13
1.2792	B.179	C.13
1.2793	B.180	C.13
1.2794	B.181	C.13
1.2795	B.182	C.13
1.2796	B.183	C.13
1.2797	B.184	C.13
1.2798	B.185	C.13
1.2799	B.186	C.13
1.2800	B.187	C.13
1.2801	B.188	C.13
1.2802	B.189	C.13
1.2803	B.190	C.13
1.2804	B.191	C.13
1.2805	B.192	C.13
1.2806	B.193	C.13
1.2807	B.194	C.13
1.2808	B.195	C.13
1.2809	B.196	C.13
1.2810	B.197	C.13
1.2811	B.198	C.13
1.2812	B.199	C.13
1.2813	B.200	C.13
1.2814	B.201	C.13
1.2815	B.1	C.14
1.2816	B.2	C.14
1.2817	B.3	C.14
1.2818	B.4	C.14
1.2819	B.5	C.14
1.2820	B.6	C.14
1.2821	B.7	C.14
1.2822	B.8	C.14
1.2823	B.9	C.14
1.2824	B.10	C.14
1.2825	B.11	C.14
1.2826	B.12	C.14
1.2827	B.13	C.14
1.2828	B.14	C.14
1.2829	B.15	C.14
1.2830	B.16	C.14
1.2831	B.17	C.14
1.2832	B.18	C.14
1.2833	B.19	C.14

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.2834	B.20	C.14
1.2835	B.21	C.14
1.2836	B.22	C.14
1.2837	B.23	C.14
1.2838	B.24	C.14
1.2839	B.25	C.14
1.2840	B.26	C.14
1.2841	B.27	C.14
1.2842	B.28	C.14
1.2843	B.29	C.14
1.2844	B.30	C.14
1.2845	B.31	C.14
1.2846	B.32	C.14
1.2847	B.33	C.14
1.2848	B.34	C.14
1.2849	B.35	C.14
1.2850	B.36	C.14
1.2851	B.37	C.14
1.2852	B.38	C.14
1.2853	B.39	C.14
1.2854	B.40	C.14
1.2855	B.41	C.14
1.2856	B.42	C.14
1.2857	B.43	C.14
1.2858	B.44	C.14
1.2859	B.45	C.14
1.2860	B.46	C.14
1.2861	B.47	C.14
1.2862	B.48	C.14
1.2863	B.49	C.14
1.2864	B.50	C.14
1.2865	B.51	C.14
1.2866	B.52	C.14
1.2867	B.53	C.14
1.2868	B.54	C.14
1.2869	B.55	C.14
1.2870	B.56	C.14
1.2871	B.57	C.14
1.2872	B.58	C.14
1.2873	B.59	C.14
1.2874	B.60	C.14
1.2875	B.61	C.14
1.2876	B.62	C.14
1.2877	B.63	C.14
1.2878	B.64	C.14
1.2879	B.65	C.14
1.2880	B.66	C.14
1.2881	B.67	C.14
1.2882	B.68	C.14

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.2883	B.69	C.14
1.2884	B.70	C.14
1.2885	B.71	C.14
1.2886	B.72	C.14
1.2887	B.73	C.14
1.2888	B.74	C.14
1.2889	B.75	C.14
1.2890	B.76	C.14
1.2891	B.77	C.14
1.2892	B.78	C.14
1.2893	B.79	C.14
1.2894	B.80	C.14
1.2895	B.81	C.14
1.2896	B.82	C.14
1.2897	B.83	C.14
1.2898	B.84	C.14
1.2899	B.85	C.14
1.2900	B.86	C.14
1.2901	B.87	C.14
1.2902	B.88	C.14
1.2903	B.89	C.14
1.2904	B.90	C.14
1.2905	B.91	C.14
1.2906	B.92	C.14
1.2907	B.93	C.14
1.2908	B.94	C.14
1.2909	B.95	C.14
1.2910	B.96	C.14
1.2911	B.97	C.14
1.2912	B.98	C.14
1.2913	B.99	C.14
1.2914	B.100	C.14
1.2915	B.101	C.14
1.2916	B.102	C.14
1.2917	B.103	C.14
1.2918	B.104	C.14
1.2919	B.105	C.14
1.2920	B.106	C.14
1.2921	B.107	C.14
1.2922	B.108	C.14
1.2923	B.109	C.14
1.2924	B.110	C.14
1.2925	B.111	C.14
1.2926	B.112	C.14
1.2927	B.113	C.14
1.2928	B.114	C.14
1.2929	B.115	C.14
1.2930	B.116	C.14
1.2931	B.117	C.14

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.2932	B.118	C.14
1.2933	B.119	C.14
1.2934	B.120	C.14
1.2935	B.121	C.14
1.2936	B.122	C.14
1.2937	B.123	C.14
1.2938	B.124	C.14
1.2939	B.125	C.14
1.2940	B.126	C.14
1.2941	B.127	C.14
1.2942	B.128	C.14
1.2943	B.129	C.14
1.2944	B.130	C.14
1.2945	B.131	C.14
1.2946	B.132	C.14
1.2947	B.133	C.14
1.2948	B.134	C.14
1.2949	B.135	C.14
1.2950	B.136	C.14
1.2951	B.137	C.14
1.2952	B.138	C.14
1.2953	B.139	C.14
1.2954	B.140	C.14
1.2955	B.141	C.14
1.2956	B.142	C.14
1.2957	B.143	C.14
1.2958	B.144	C.14
1.2959	B.145	C.14
1.2960	B.146	C.14
1.2961	B.147	C.14
1.2962	B.148	C.14
1.2963	B.149	C.14
1.2964	B.150	C.14
1.2965	B.151	C.14
1.2966	B.152	C.14
1.2967	B.153	C.14
1.2968	B.154	C.14
1.2969	B.155	C.14
1.2970	B.156	C.14
1.2971	B.157	C.14
1.2972	B.158	C.14
1.2973	B.159	C.14
1.2974	B.160	C.14
1.2975	B.161	C.14
1.2976	B.162	C.14
1.2977	B.163	C.14
1.2978	B.164	C.14
1.2979	B.165	C.14
1.2980	B.166	C.14

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.2981	B.167	C.14
1.2982	B.168	C.14
1.2983	B.169	C.14
1.2984	B.170	C.14
1.2985	B.171	C.14
1.2986	B.172	C.14
1.2987	B.173	C.14
1.2988	B.174	C.14
1.2989	B.175	C.14
1.2990	B.176	C.14
1.2991	B.177	C.14
1.2992	B.178	C.14
1.2993	B.179	C.14
1.2994	B.180	C.14
1.2995	B.181	C.14
1.2996	B.182	C.14
1.2997	B.183	C.14
1.2998	B.184	C.14
1.2999	B.185	C.14
1.3000	B.186	C.14
1.3001	B.187	C.14
1.3002	B.188	C.14
1.3003	B.189	C.14
1.3004	B.190	C.14
1.3005	B.191	C.14
1.3006	B.192	C.14
1.3007	B.193	C.14
1.3008	B.194	C.14
1.3009	B.195	C.14
1.3010	B.196	C.14
1.3011	B.197	C.14
1.3012	B.198	C.14
1.3013	B.199	C.14
1.3014	B.200	C.14
1.3015	B.201	C.14
1.3016	B.1	C.15
1.3017	B.2	C.15
1.3018	B.3	C.15
1.3019	B.4	C.15
1.3020	B.5	C.15
1.3021	B.6	C.15
1.3022	B.7	C.15
1.3023	B.8	C.15
1.3024	B.9	C.15
1.3025	B.10	C.15
1.3026	B.11	C.15
1.3027	B.12	C.15
1.3028	B.13	C.15
1.3029	B.14	C.15

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.3030	B.15	C.15
1.3031	B.16	C.15
1.3032	B.17	C.15
1.3033	B.18	C.15
1.3034	B.19	C.15
1.3035	B.20	C.15
1.3036	B.21	C.15
1.3037	B.22	C.15
1.3038	B.23	C.15
1.3039	B.24	C.15
1.3040	B.25	C.15
1.3041	B.26	C.15
1.3042	B.27	C.15
1.3043	B.28	C.15
1.3044	B.29	C.15
1.3045	B.30	C.15
1.3046	B.31	C.15
1.3047	B.32	C.15
1.3048	B.33	C.15
1.3049	B.34	C.15
1.3050	B.35	C.15
1.3051	B.36	C.15
1.3052	B.37	C.15
1.3053	B.38	C.15
1.3054	B.39	C.15
1.3055	B.40	C.15
1.3056	B.41	C.15
1.3057	B.42	C.15
1.3058	B.43	C.15
1.3059	B.44	C.15
1.3060	B.45	C.15
1.3061	B.46	C.15
1.3062	B.47	C.15
1.3063	B.48	C.15
1.3064	B.49	C.15
1.3065	B.50	C.15
1.3066	B.51	C.15
1.3067	B.52	C.15
1.3068	B.53	C.15
1.3069	B.54	C.15
1.3070	B.55	C.15
1.3071	B.56	C.15
1.3072	B.57	C.15
1.3073	B.58.	C.15
1.3074	B.59	C.15
1.3075	B.60	C.15
1.3076	B.61	C.15
1.3077	B.62	C.15
1.3078	B.63	C.15

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.3079	B.64	C.15
1.3080	B.65	C.15
1.3081	B.66	C.15
1.3082	B.67	C.15
1.3083	B.68	C.15
1.3084	B.69	C.15
1.3085	B.70	C.15
1.3086	B.71	C.15
1.3087	B.72	C.15
1.3088	B.73	C.15
1.3089	B.74	C.15
1.3090	B.75	C.15
1.3091	B.76	C.15
1.3092	B.77	C.15
1.3093	B.78	C.15
1.3094	B.79	C.15
1.3095	B.80	C.15
1.3096	B.81	C.15
1.3097	B.82	C.15
1.3098	B.83	C.15
1.3099	B.84	C.15
1.3100	B.85	C.15
1.3101	B.86	C.15
1.3102	B.87	C.15
1.3103	B.88	C.15
1.3104	B.89	C.15
1.3105	B.90	C.15
1.3106	B.91	C.15
1.3107	B.92	C.15
1.3108	B.93	C.15
1.3109	B.94	C.15
1.3110	B.95	C.15
1.3111	B.96	C.15
1.3112	B.97	C.15
1.3113	B.98	C.15
1.3114	B.99	C.15
1.3115	B.100	C.15
1.3116	B.101	C.15
1.3117	B.102	C.15
1.3118	B.103	C.15
1.3119	B.104	C.15
1.3120	B.105	C.15
1.3121	B.106	C.15
1.3122	B.107	C.15
1.3123	B.108	C.15
1.3124	B.109	C.15
1.3125	B.110	C.15
1.3126	B.111	C.15
1.3127	B.112	C.15

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.3128	B.113	C.15
1.3129	B.114	C.15
1.3130	B.115	C.15
1.3131	B.116	C.15
1.3132	B.117	C.15
1.3133	B.118	C.15
1.3134	B.119	C.15
1.3135	B.120	C.15
1.3136	B.121	C.15
1.3137	B.122	C.15
1.3138	B.123	C.15
1.3139	B.124	C.15
1.3140	B.125	C.15
1.3141	B.126	C.15
1.3142	B.127	C.15
1.3143	B.128	C.15
1.3144	B.129	C.15
1.3145	B.130	C.15
1.3146	B.131	C.15
1.3147	B.132	C.15
1.3148	B.133	C.15
1.3149	B.134	C.15
1.3150	B.135	C.15
1.3151	B.136	C.15
1.3152	B.137	C.15
1.3153	B.138	C.15
1.3154	B.139	C.15
1.3155	B.140	C.15
1.3156	B.141	C.15
1.3157	B.142	C.15
1.3158	B.143	C.15
1.3159	B.144	C.15
1.3160	B.145	C.15
1.3161	B.146	C.15
1.3162	B.147	C.15
1.3163	B.148	C.15
1.3164	B.149	C.15
1.3165	B.150	C.15
1.3166	B.151	C.15
1.3167	B.152	C.15
1.3168	B.153	C.15
1.3169	B.154	C.15
1.3170	B.155	C.15
1.3171	B.156	C.15
1.3172	B.157	C.15
1.3173	B.158	C.15
1.3174	B.159	C.15
1.3175	B.160	C.15
1.3176	B.161	C.15

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.3177	B.162	C.15
1.3178	B.163	C.15
1.3179	B.164	C.15
1.3180	B.165	C.15
1.3181	B.166	C.15
1.3182	B.167	C.15
1.3183	B.168	C.15
1.3184	B.169	C.15
1.3185	B.170	C.15
1.3186	B.171	C.15
1.3187	B.172	C.15
1.3188	B.173	C.15
1.3189	B.174	C.15
1.3190	B.175	C.15
1.3191	B.176	C.15
1.3192	B.177	C.15
1.3193	B.178	C.15
1.3194	B.179	C.15
1.3195	B.180	C.15
1.3196	B.181	C.15
1.3197	B.182	C.15
1.3198	B.183	C.15
1.3199	B.184	C.15
1.3200	B.185	C.15
1.3201	B.186	C.15
1.3202	B.187	C.15
1.3203	B.188	C.15
1.3204	B.189	C.15
1.3205	B.190	C.15
1.3206	B.191	C.15
1.3207	B.192	C.15
1.3208	B.193	C.15
1.3209	B.194	C.15
1.3210	B.195	C.15
1.3211	B.196	C.15
1.3212	B.197	C.15
1.3213	B.198	C.15
1.3214	B.199	C.15
1.3215	B.200	C.15
1.3216	B.201	C.15
1.3217	B.1	C.16
1.3218	B.2	C.16
1.3219	B.3	C.16
1.3220	B.4	C.16
1.3221	B.5	C.16
1.3222	B.6	C.16
1.3223	B.7	C.16
1.3224	B.8	C.16
1.3225	B.9	C.16

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.3226	B.10	C.16
1.3227	B.11	C.16
1.3228	B.12	C.16
1.3229	B.13	C.16
1.3230	B.14	C.16
1.3231	B.15	C.16
1.3232	B.16	C.16
1.3233	B.17	C.16
1.3234	B.18	C.16
1.3235	B.19	C.16
1.3236	B.20	C.16
1.3237	B.21	C.16
1.3238	B.22	C.16
1.3239	B.23	C.16
1.3240	B.24	C.16
1.3241	B.25	C.16
1.3242	B.26	C.16
1.3243	B.27	C.16
1.3244	B.28	C.16
1.3245	B.29	C.16
1.3246	B.30	C.16
1.3247	B.31	C.16
1.3248	B.32	C.16
1.3249	B.33	C.16
1.3250	B.34	C.16
1.3251	B.35	C.16
1.3252	B.36	C.16
1.3253	B.37	C.16
1.3254	B.38	C.16
1.3255	B.39	C.16
1.3256	B.40	C.16
1.3257	B.41	C.16
1.3258	B.42	C.16
1.3259	B.43	C.16
1.3260	B.44	C.16
1.3261	B.45	C.16
1.3262	B.46	C.16
1.3263	B.47	C.16
1.3264	B.48	C.16
1.3265	B.49	C.16
1.3266	B.50	C.16
1.3267	B.51	C.16
1.3268	B.52	C.16
1.3269	B.53	C.16
1.3270	B.54	C.16
1.3271	B.55	C.16
1.3272	B.56	C.16
1.3273	B.57	C.16
1.3274	B.58.	C.16

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.3275	B.59	C.16
1.3276	B.60	C.16
1.3277	B.61	C.16
1.3278	B.62	C.16
1.3279	B.63	C.16
1.3280	B.64	C.16
1.3281	B.65	C.16
1.3282	B.66	C.16
1.3283	B.67	C.16
1.3284	B.68	C.16
1.3285	B.69	C.16
1.3286	B.70	C.16
1.3287	B.71	C.16
1.3288	B.72	C.16
1.3289	B.73	C.16
1.3290	B.74	C.16
1.3291	B.75	C.16
1.3292	B.76	C.16
1.3293	B.77	C.16
1.3294	B.78	C.16
1.3295	B.79	C.16
1.3296	B.80	C.16
1.3297	B.81	C.16
1.3298	B.82	C.16
1.3299	B.83	C.16
1.3300	B.84	C.16
1.3301	B.85	C.16
1.3302	B.86	C.16
1.3303	B.87	C.16
1.3304	B.88	C.16
1.3305	B.89	C.16
1.3306	B.90	C.16
1.3307	B.91	C.16
1.3308	B.92	C.16
1.3309	B.93	C.16
1.3310	B.94	C.16
1.3311	B.95	C.16
1.3312	B.96	C.16
1.3313	B.97	C.16
1.3314	B.98	C.16
1.3315	B.99	C.16
1.3316	B.100	C.16
1.3317	B.101	C.16
1.3318	B.102	C.16
1.3319	B.103	C.16
1.3320	B.104	C.16
1.3321	B.105	C.16
1.3322	B.106	C.16
1.3323	B.107	C.16

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.3324	B.108	C.16
1.3325	B.109	C.16
1.3326	B.110	C.16
1.3327	B.111	C.16
1.3328	B.112	C.16
1.3329	B.113	C.16
1.3330	B.114	C.16
1.3331	B.115	C.16
1.3332	B.116	C.16
1.3333	B.117	C.16
1.3334	B.118	C.16
1.3335	B.119	C.16
1.3336	B.120	C.16
1.3337	B.121	C.16
1.3338	B.122	C.16
1.3339	B.123	C.16
1.3340	B.124	C.16
1.3341	B.125	C.16
1.3342	B.126	C.16
1.3343	B.127	C.16
1.3344	B.128	C.16
1.3345	B.129	C.16
1.3346	B.130	C.16
1.3347	B.131	C.16
1.3348	B.132	C.16
1.3349	B.133	C.16
1.3350	B.134	C.16
1.3351	B.135	C.16
1.3352	B.136	C.16
1.3353	B.137	C.16
1.3354	B.138	C.16
1.3355	B.139	C.16
1.3356	B.140	C.16
1.3357	B.141	C.16
1.3358	B.142	C.16
1.3359	B.143	C.16
1.3360	B.144	C.16
1.3361	B.145	C.16
1.3362	B.146	C.16
1.3363	B.147	C.16
1.3364	B.148	C.16
1.3365	B.149	C.16
1.3366	B.150	C.16
1.3367	B.151	C.16
1.3368	B.152	C.16
1.3369	B.153	C.16
1.3370	B.154	C.16
1.3371	B.155	C.16
1.3372	B.156	C.16

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C	組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C	組成物 no.	除草 剤B	葉害 軽減 剤C
1.3373	B.157	C.16	1.3422	B.5	C.17	1.3471	B.54	C.17
1.3374	B.158	C.16	1.3423	B.6	C.17	1.3472	B.55	C.17
1.3375	B.159	C.16	1.3424	B.7	C.17	1.3473	B.56	C.17
1.3376	B.160	C.16	1.3425	B.8	C.17	1.3474	B.57	C.17
1.3377	B.161	C.16	1.3426	B.9	C.17	1.3475	B.58	C.17
1.3378	B.162	C.16	1.3427	B.10	C.17	1.3476	B.59	C.17
1.3379	B.163	C.16	1.3428	B.11	C.17	1.3477	B.60	C.17
1.3380	B.164	C.16	1.3429	B.12	C.17	1.3478	B.61	C.17
1.3381	B.165	C.16	1.3430	B.13	C.17	1.3479	B.62	C.17
1.3382	B.166	C.16	1.3431	B.14	C.17	1.3480	B.63	C.17
1.3383	B.167	C.16	1.3432	B.15	C.17	1.3481	B.64	C.17
1.3384	B.168	C.16	1.3433	B.16	C.17	1.3482	B.65	C.17
1.3385	B.169	C.16	1.3434	B.17	C.17	1.3483	B.66	C.17
1.3386	B.170	C.16	1.3435	B.18	C.17	1.3484	B.67	C.17
1.3387	B.171	C.16	1.3436	B.19	C.17	1.3485	B.68	C.17
1.3388	B.172	C.16	1.3437	B.20	C.17	1.3486	B.69	C.17
1.3389	B.173	C.16	1.3438	B.21	C.17	1.3487	B.70	C.17
1.3390	B.174	C.16	1.3439	B.22	C.17	1.3488	B.71	C.17
1.3391	B.175	C.16	1.3440	B.23	C.17	1.3489	B.72	C.17
1.3392	B.176	C.16	1.3441	B.24	C.17	1.3490	B.73	C.17
1.3393	B.177	C.16	1.3442	B.25	C.17	1.3491	B.74	C.17
1.3394	B.178	C.16	1.3443	B.26	C.17	1.3492	B.75	C.17
1.3395	B.179	C.16	1.3444	B.27	C.17	1.3493	B.76	C.17
1.3396	B.180	C.16	1.3445	B.28	C.17	1.3494	B.77	C.17
1.3397	B.181	C.16	1.3446	B.29	C.17	1.3495	B.78	C.17
1.3398	B.182	C.16	1.3447	B.30	C.17	1.3496	B.79	C.17
1.3399	B.183	C.16	1.3448	B.31	C.17	1.3497	B.80	C.17
1.3400	B.184	C.16	1.3449	B.32	C.17	1.3498	B.81	C.17
1.3401	B.185	C.16	1.3450	B.33	C.17	1.3499	B.82	C.17
1.3402	B.186	C.16	1.3451	B.34	C.17	1.3500	B.83	C.17
1.3403	B.187	C.16	1.3452	B.35	C.17	1.3501	B.84	C.17
1.3404	B.188	C.16	1.3453	B.36	C.17	1.3502	B.85	C.17
1.3405	B.189	C.16	1.3454	B.37	C.17	1.3503	B.86	C.17
1.3406	B.190	C.16	1.3455	B.38	C.17	1.3504	B.87	C.17
1.3407	B.191	C.16	1.3456	B.39	C.17	1.3505	B.88	C.17
1.3408	B.192	C.16	1.3457	B.40	C.17	1.3506	B.89	C.17
1.3409	B.193	C.16	1.3458	B.41	C.17	1.3507	B.90	C.17
1.3410	B.194	C.16	1.3459	B.42	C.17	1.3508	B.91	C.17
1.3411	B.195	C.16	1.3460	B.43	C.17	1.3509	B.92	C.17
1.3412	B.196	C.16	1.3461	B.44	C.17	1.3510	B.93	C.17
1.3413	B.197	C.16	1.3462	B.45	C.17	1.3511	B.94	C.17
1.3414	B.198	C.16	1.3463	B.46	C.17	1.3512	B.95	C.17
1.3415	B.199	C.16	1.3464	B.47	C.17	1.3513	B.96	C.17
1.3416	B.200	C.16	1.3465	B.48	C.17	1.3514	B.97	C.17
1.3417	B.201	C.16	1.3466	B.49	C.17	1.3515	B.98	C.17
1.3418	B.1	C.17	1.3467	B.50	C.17	1.3516	B.99	C.17
1.3419	B.2	C.17	1.3468	B.51	C.17	1.3517	B.100	C.17
1.3420	B.3	C.17	1.3469	B.52	C.17	1.3518	B.101	C.17
1.3421	B.4	C.17	1.3470	B.53	C.17	1.3519	B.102	C.17

10

20

30

40

50

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.3520	B.103	C.17
1.3521	B.104	C.17
1.3522	B.105	C.17
1.3523	B.106	C.17
1.3524	B.107	C.17
1.3525	B.108	C.17
1.3526	B.109	C.17
1.3527	B.110	C.17
1.3528	B.111	C.17
1.3529	B.112	C.17
1.3530	B.113	C.17
1.3531	B.114	C.17
1.3532	B.115	C.17
1.3533	B.116	C.17
1.3534	B.117	C.17
1.3535	B.118	C.17
1.3536	B.119	C.17
1.3537	B.120	C.17
1.3538	B.121	C.17
1.3539	B.122	C.17
1.3540	B.123	C.17
1.3541	B.124	C.17
1.3542	B.125	C.17
1.3543	B.126	C.17
1.3544	B.127	C.17
1.3545	B.128	C.17
1.3546	B.129	C.17
1.3547	B.130	C.17
1.3548	B.131	C.17
1.3549	B.132	C.17
1.3550	B.133	C.17
1.3551	B.134	C.17
1.3552	B.135	C.17
1.3553	B.136	C.17
1.3554	B.137	C.17
1.3555	B.138	C.17
1.3556	B.139	C.17
1.3557	B.140	C.17
1.3558	B.141	C.17
1.3559	B.142	C.17
1.3560	B.143	C.17
1.3561	B.144	C.17
1.3562	B.145	C.17
1.3563	B.146	C.17
1.3564	B.147	C.17
1.3565	B.148	C.17

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.3566	B.149	C.17
1.3567	B.150	C.17
1.3568	B.151	C.17
1.3569	B.152	C.17
1.3570	B.153	C.17
1.3571	B.154	C.17
1.3572	B.155	C.17
1.3573	B.156	C.17
1.3574	B.157	C.17
1.3575	B.158	C.17
1.3576	B.159	C.17
1.3577	B.160	C.17
1.3578	B.161	C.17
1.3579	B.162	C.17
1.3580	B.163	C.17
1.3581	B.164	C.17
1.3582	B.165	C.17
1.3583	B.166	C.17
1.3584	B.167	C.17
1.3585	B.168	C.17
1.3586	B.169	C.17
1.3587	B.170	C.17
1.3588	B.171	C.17
1.3589	B.172	C.17
1.3590	B.173	C.17
1.3591	B.174	C.17
1.3592	B.175	C.17
1.3593	B.176	C.17
1.3594	B.177	C.17
1.3595	B.178	C.17
1.3596	B.179	C.17
1.3597	B.180	C.17
1.3598	B.181	C.17
1.3599	B.182	C.17
1.3600	B.183	C.17
1.3601	B.184	C.17
1.3602	B.185	C.17
1.3603	B.186	C.17
1.3604	B.187	C.17
1.3605	B.188	C.17
1.3606	B.189	C.17
1.3607	B.190	C.17
1.3608	B.191	C.17
1.3609	B.192	C.17
1.3610	B.193	C.17
1.3611	B.194	C.17

組成物 no.	除草 剤B	薬害 軽減 剤C
1.3612	B.195	C.17
1.3613	B.196	C.17
1.3614	B.197	C.17
1.3615	B.198	C.17
1.3616	B.199	C.17
1.3617	B.200	C.17
1.3618	B.201	C.17
1.3619	--	C.1
1.3620	--	C.2
1.3621	--	C.3
1.3622	--	C.4
1.3623	--	C.5
1.3624	--	C.6
1.3625	--	C.7
1.3626	--	C.8
1.3627	--	C.9
1.3628	--	C.10
1.3629	--	C.11
1.3630	--	C.12
1.3631	--	C.13
1.3632	--	C.14
1.3633	--	C.15
1.3634	--	C.16
1.3635	--	C.17
1.3636	B.202	--
1.3637	B.202	C.1
1.3638	B.202	C.2
1.3639	B.202	C.3
1.3640	B.202	C.4
1.3641	B.202	C.5
1.3642	B.202	C.6
1.3643	B.202	C.7
1.3644	B.202	C.8
1.3645	B.202	C.9
1.3646	B.202	C.10
1.3647	B.202	C.11
1.3648	B.202	C.12
1.3649	B.202	C.13
1.3650	B.202	C.14
1.3651	B.202	C.15
1.3652	B.202	C.16
1.3653	B.202	C.17

10

20

30

40

【0483】

各单一組成物についての特定の番号は、以下のように推論できる：

【0484】

組成物1.200は、例えば、ウラシルピリジン1.a.339及びシンメチリン(B.200)(表1の項目1.200、及び表Bの項目B.200を参照されたい)を含む。

【0485】

組成物2.200は、例えば、ウラシルピリジン1.a.109(以下の組成物2.1 ~ 2.3653、好ましくは2.1 ~ 2.3635に関する定義を参照されたい)及びシンメチリン(B.200)(表1の項目1.200、及び表Bの項目B.200を参照されたい)を含む。

50

【 0 4 8 6 】

組成物7.200は、例えば、イマザピル(B.35)(以下の組成物7.1～7.3653、好ましくは7.1～7.3635に関する定義を参照されたい)、ウラシルピリジンI.a.339、及びシンメチリン(B.200)(表1の項目1.200、及び表Bの項目B.200を参照されたい)を含む。

【 0 4 8 7 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.a.109)のウラシルピリジンを含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物2.1～2.3653、より好ましくは2.1～2.3635である。

【 0 4 8 8 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.2を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物3.1～3.3653、より好ましくは3.1～3.3635である。

10

【 0 4 8 9 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.8を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物4.1～4.3653、より好ましくは4.1～4.3635である。

【 0 4 9 0 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.30を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物5.1～5.3653、より好ましくは5.1～5.3635である。

20

【 0 4 9 1 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.32を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物6.1～6.3653、より好ましくは6.1～6.3635である。

【 0 4 9 2 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.35を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物7.1～7.3653、より好ましくは7.1～7.3635である。

【 0 4 9 3 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.38を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物8.1～8.3653、より好ましくは8.1～8.3635である。

30

【 0 4 9 4 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.40を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物9.1～9.3653、より好ましくは9.1～9.3635である。

【 0 4 9 5 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.51を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物10.1～10.3653、より好ましくは10.1～10.3635である。

40

【 0 4 9 6 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.55を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物11.1～11.3653、より好ましくは11.1～11.3635である。

【 0 4 9 7 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.56を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物12.1～12.3653、より好ましくは12.1～12.3635である。

【 0 4 9 8 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.64を付加的に含むという点に

50

おいてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物13.1～13.3653、より好ましくは13.1～13.3635である。

【0499】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.66を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物14.1～14.3653、より好ましくは14.1～14.3635である。

【0500】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.67を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物15.1～15.3653、より好ましくは15.1～15.3635である。

10

【0501】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.68を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物16.1～16.3653、より好ましくは16.1～16.3635である。

【0502】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.69を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物17.1～17.3653、より好ましくは17.1～17.3635である。

20

【0503】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.73を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物18.1～18.3653、より好ましくは18.1～18.3635である。

【0504】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.76を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物19.1～19.3653、より好ましくは19.1～19.3635である。

30

【0505】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.81を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物20.1～20.3653、より好ましくは20.1～20.3635である。

【0506】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.82を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物21.1～21.3653、より好ましくは21.1～21.3635である。

30

【0507】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.85を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物22.1～22.3653、より好ましくは22.1～22.3635である。

【0508】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.88を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物23.1～23.3653、より好ましくは23.1～23.3635である。

40

【0509】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.89を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物24.1～24.3653、より好ましくは24.1～24.3635である。

【0510】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.94を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物25.1～25.3653、より好ましくは25.1～25.3635である。

50

【 0 5 1 1 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.95を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物26.1～26.3653、より好ましくは26.1～26.3635である。

【 0 5 1 2 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.98を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物27.1～27.3653、より好ましくは27.1～27.3635である。

【 0 5 1 3 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.100を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物28.1～28.3653、より好ましくは28.1～28.3635である。

10

【 0 5 1 4 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.103を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物29.1～29.3653、より好ましくは29.1～29.3635である。

【 0 5 1 5 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.103とB.67を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物30.1～30.3653、より好ましくは30.1～30.3635である。

20

【 0 5 1 6 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.103とB.76を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物31.1～31.3653、より好ましくは31.1～31.3635である。

【 0 5 1 7 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.103とB.82を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物32.1～32.3653、より好ましくは32.1～32.3635である。

【 0 5 1 8 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.104を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物33.1～33.3653、より好ましくは33.1～33.3635である。

30

【 0 5 1 9 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.104とB.67を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物34.1～34.3653、より好ましくは34.1～34.3635である。

【 0 5 2 0 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.104とB.76を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物35.1～35.3653、より好ましくは35.1～35.3635である。

40

【 0 5 2 1 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.104とB.82を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物36.1～36.3653、より好ましくは36.1～36.3635である。

【 0 5 2 2 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.106を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物37.1～37.3653、より好ましくは37.1～37.3635である。

【 0 5 2 3 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.107を付加的に含むという点

50

においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物38.1～38.3653、より好ましくは38.1～38.3635である。

【0524】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.107とB.67を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物39.1～39.3653、より好ましくは39.1～39.3635である。

【0525】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.107とB.76を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物40.1～40.3653、より好ましくは40.1～40.3635である。

10

【0526】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.107とB.82を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物41.1～41.3653、より好ましくは41.1～41.3635である。

【0527】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.109を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物42.1～42.3653、より好ましくは42.1～42.3635である。

【0528】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.111を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物43.1～43.3653、より好ましくは43.1～43.3635である。

20

【0529】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.111とB.67を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物44.1～44.3653、より好ましくは44.1～44.3635である。

【0530】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.111とB.76を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物45.1～45.3653、より好ましくは45.1～45.3635である。

30

【0531】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.111とB.82を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物46.1～46.3653、より好ましくは46.1～46.3635である。

【0532】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.116を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物47.1～47.3653、より好ましくは47.1～47.3635である。

【0533】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.116とB.67を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物48.1～48.3653、より好ましくは48.1～48.3635である。

40

【0534】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.116とB.94を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物49.1～49.3653、より好ましくは49.1～49.3635である。

【0535】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.116とB.103を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物50.1～50.3653、より好ましくは50.1～50.3635である。

50

【 0 5 3 6 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.116とB.128を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物51.1～51.3653、より好ましくは51.1～51.3635である。

【 0 5 3 7 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.116とB.104を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物52.1～52.3653、より好ましくは52.1～52.3635である。

【 0 5 3 8 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.116とB.107を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物53.1～53.3653、より好ましくは53.1～53.3635である。

10

【 0 5 3 9 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.116とB.111を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物54.1～54.3653、より好ましくは54.1～54.3635である。

【 0 5 4 0 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.122を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物55.1～55.3653、より好ましくは55.1～55.3635である。

20

【 0 5 4 1 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.126を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物56.1～56.3653、より好ましくは56.1～56.3635である。

【 0 5 4 2 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.128を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物57.1～57.3653、より好ましくは57.1～57.3635である。

【 0 5 4 3 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.131を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物58.1～58.3653、より好ましくは58.1～58.3635である。

30

【 0 5 4 4 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.132を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物59.1～59.3653、より好ましくは59.1～59.3635である。

【 0 5 4 5 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.133を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物60.1～60.3653、より好ましくは60.1～60.3635である。

40

【 0 5 4 6 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.135を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物61.1～61.3653、より好ましくは61.1～61.3635である。

【 0 5 4 7 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.137を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物62.1～62.3653、より好ましくは62.1～62.3635である。

【 0 5 4 8 】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.138を付加的に含むという点

50

においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは11.1～1.3635と異なる、組成物63.1～63.3653、より好ましくは63.1～63.3635である。

【0549】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.140を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物64.1～64.3653、より好ましくは64.1～64.3635である。

【0550】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.145を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物65.1～65.3653、より好ましくは65.1～65.3635である。

10

【0551】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.153を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物66.1～66.3653、より好ましくは66.1～66.3635である。

【0552】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.156を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物67.1～67.3653、より好ましくは67.1～67.3635である。

【0553】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.171を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物68.1～68.3653、より好ましくは68.1～68.3635である。

20

【0554】

同様にとりわけ好ましいのは、さらなる除草剤BとしてB.174を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物69.1～69.3653、より好ましくは69.1～69.3635である。

【0555】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.a.115)のウラシルピリジンを含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物70.1～70.3653、より好ましくは70.1～70.3635である。

30

【0556】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.a.255)のウラシルピリジンを含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物71.1～71.3653、より好ましくは71.1～71.3635である。

【0557】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.a.277)のウラシルピリジンを含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物72.1～72.3653、より好ましくは72.1～72.3635である。

【0558】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.a.283)のウラシルピリジンを含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物73.1～73.3653、より好ましくは73.1～73.3635である。

40

【0559】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.a.87)のウラシルピリジンを含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物74.1～74.3653、より好ましくは74.1～74.3635である。

【0560】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.a.361)のウラシルピリジンを含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物75.1～75.3653、より好ましくは75.1～75.3635である。

50

【0561】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.a.367)のウラシルピリジンを含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物76.1～76.3653、より好ましくは76.1～76.3635である。

【0562】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.87)のウラシルピリジンを含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物77.1～77.3653、より好ましくは77.1～77.3635である。

【0563】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.109)のウラシルピリジンを含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物78.1～78.3653、より好ましくは78.1～78.3635である。

10

【0564】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.115)のウラシルピリジンを含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物79.1～79.3653、より好ましくは79.1～79.3635である。

【0565】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.255)のウラシルピリジンを含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物80.1～80.3653、より好ましくは80.1～80.3635である。

20

【0566】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.277)のウラシルピリジンを含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物81.1～81.3653、より好ましくは81.1～81.3635である。

【0567】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.283)のウラシルピリジンを含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物82.1～82.3653、より好ましくは82.1～82.3635である。

【0568】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物83.1～83.3653、より好ましくは83.1～83.3635である。

30

【0569】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.361)のウラシルピリジンを含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物84.1～84.3653、より好ましくは84.1～84.3635である。

【0570】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.367)のウラシルピリジンを含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物85.1～85.3653、より好ましくは85.1～85.3635である。

40

【0571】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.2を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物86.1～86.3653、より好ましくは86.1～86.3635である。

【0572】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.8を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物87.1～87.3653、より好ましくは87.1～87.3635である。

50

【 0 5 7 3 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.30を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物88.1～88.3653、より好ましくは88.1～88.3635である。

【 0 5 7 4 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.32を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物89.1～89.3653、より好ましくは89.1～89.3635である。

10

【 0 5 7 5 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.35を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物90.1～90.3653、より好ましくは90.1～90.3635である。

【 0 5 7 6 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.38を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物91.1～91.3653、より好ましくは91.1～91.3635である。

20

【 0 5 7 7 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.40を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物92.1～92.3653、より好ましくは92.1～92.3635である。

【 0 5 7 8 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.51を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物93.1～93.3653、より好ましくは93.1～93.3635である。

30

【 0 5 7 9 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.55を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物94.1～94.3653、より好ましくは94.1～94.3635である。

【 0 5 8 0 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.56を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物95.1～95.3653、より好ましくは95.1～95.3635である。

40

【 0 5 8 1 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.64を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物96.1～96.3653、より好ましくは96.1～96.3635である。

【 0 5 8 2 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.66を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物97.1～97.3653、より好ましくは97.1～97.3635である。

50

【0583】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.67を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物98.1～98.3653、より好ましくは98.1～98.3635である。

【0584】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.68を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物99.1～99.3653、より好ましくは99.1～99.3635である。

10

【0585】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.69を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物100.1～100.3653、より好ましくは100.1～100.3635である。

【0586】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.73を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物101.1～101.3653、より好ましくは101.1～101.3635である。

20

【0587】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.76を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物102.1～102.3653、より好ましくは102.1～102.3635である。

【0588】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.81を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物103.1～103.3653、より好ましくは103.1～103.3635である。

30

【0589】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.82を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物104.1～104.3653、より好ましくは104.1～104.3635である。

【0590】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.85を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物105.1～105.3653、より好ましくは105.1～105.3635である。

40

【0591】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.88を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物106.1～106.3653、より好ましくは106.1～106.3635である。

【0592】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.89を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物107.1～107.3653、より好ましくは107.1～107.3635である。

50

【0593】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.94を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物108.1～108.3653、より好ましくは108.1～108.3635である。

【0594】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.95を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物191.1～109.3653、より好ましくは109.1～109.3635である。

10

【0595】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.98を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物110.1～110.3653、より好ましくは110.1～110.3635である。

【0596】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.100を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物111.1～111.3653、より好ましくは111.1～111.3635である。

20

【0597】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.103を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物112.1～112.3653、より好ましくは112.1～112.3635である。

【0598】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.103とB.67を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物113.1～113.3653、より好ましくは113.1～113.3635である。

30

【0599】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.103とB.76を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物114.1～114.3653、より好ましくは114.1～114.3635である。

【0600】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.103とB.82を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物115.1～115.3653、より好ましくは115.1～115.3635である。

40

【0601】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.104を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物116.1～116.3653、より好ましくは116.1～116.3635である。

【0602】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.104とB.67を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物117.1～117.3653、より好ましくは117.1～117.3635である。

50

【0603】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.104とB.76を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物118.1～118.3653、より好ましくは118.1～1118.3635である。

【0604】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.104とB.82を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物119.1～119.3653、より好ましくは119.1～119.3635である。

10

【0605】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.106を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物120.1～120.3653、より好ましくは120.1～120.3635である。

【0606】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.107を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物121.1～121.3653、より好ましくは121.1～121.3635である。

20

【0607】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.107とB.67を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物122.1～122.3653、より好ましくは122.1～122.3635である。

【0608】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.107とB.76を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物123.1～123.3653、より好ましくは123.1～123.3635である。

30

【0609】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.107とB.82を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物124.1～124.3653、より好ましくは124.1～124.3635である。

【0610】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.109を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物125.1～125.3653、より好ましくは125.1～125.3635である。

40

【0611】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.111を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物126.1～126.3653、より好ましくは126.1～126.3635である。

【0612】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.111とB.67を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物127.1～127.3653、より好ましくは127.1～127.3635である。

50

【0613】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.111とB.76を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物128.1～128.3653、より好ましくは128.1～128.3635である。

【0614】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.111とB.82を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物129.1～129.3653、より好ましくは129.1～129.3635である。

10

【0615】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.116を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物130.1～130.3653、より好ましくは130.1～130.3635である。

【0616】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.116とB.67を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物131.1～131.3653、より好ましくは131.1～131.3635である。

20

【0617】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.116とB.94を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物132.1～132.3653、より好ましくは132.1～132.3635である。

【0618】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.116とB.103を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物133.1～133.3653、より好ましくは133.1～133.3635である。

30

【0619】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.116とB.128を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物134.1～134.3653、より好ましくは134.1～134.3635である。

【0620】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.116とB.104を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物135.1～135.3653、より好ましくは135.1～135.3635である。

40

【0621】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.116とB.107を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物136.1～136.3653、より好ましくは136.1～136.3635である。

【0622】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.116とB.111を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物137.1～137.3653、より好ましくは137.1～137.3635である。

50

【 0 6 2 3 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.122を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物138.1～138.3653、より好ましくは138.1～138.3635である。

【 0 6 2 4 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.126を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物139.1～139.3653、より好ましくは139.1～139.3635である。

10

【 0 6 2 5 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.128を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物140.1～140.3653、より好ましくは140.1～140.3635である。

【 0 6 2 6 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.131を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物141.1～141.3653、より好ましくは141.1～141.3635である。

20

【 0 6 2 7 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.132を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物142.1～142.3653、より好ましくは142.1～142.3635である。

【 0 6 2 8 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.133を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物143.1～143.3653、より好ましくは143.1～143.3635である。

30

【 0 6 2 9 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.135を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物144.1～144.3653、より好ましくは144.1～144.3635である。

【 0 6 3 0 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.137を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物145.1～145.3653、より好ましくは145.1～145.3635である。

40

【 0 6 3 1 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.138を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物146.1～146.3653、より好ましくは146.1～146.3635である。

【 0 6 3 2 】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.140を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物147.1～147.3653、より好ましくは147.1～147.3635である。

50

【0633】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.145を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物148.1～148.3653、より好ましくは148.1～148.3635である。

【0634】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.153を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物149.1～149.3653、より好ましくは149.1～149.3635である。

10

【0635】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.156を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物150.1～150.3653、より好ましくは150.1～150.3635である。

【0636】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.171を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物151.1～151.3653、より好ましくは151.1～151.3635である。

20

【0637】

同様に、とりわけ好ましいのは、活性化合物Aとして式(I.h.339)のウラシルピリジンを含み、さらなる除草剤BとしてB.174を付加的に含むという点においてのみ対応する組成物1.1～1.3653、より好ましくは1.1～1.3635と異なる、組成物152.1～152.3653、より好ましくは152.1～152.3635である。

【0638】

本発明はまた、助剤と本発明による少なくとも1種の式(I)のウラシルピリジンとを含む農薬組成物にも関する。

【0639】

農薬組成物は、殺有害生物有効量の式(I)のウラシルピリジンを含む。用語「有効量」は、不要な植物を防除するため、とりわけ栽培植物における不要な植物を防除するためには十分であるが、処理対象の植物には実質的な損害をもたらさない、組成物又は化合物Iの量を意味する。この量は、広範囲に変動する可能性があり、防除対象の植物、処理対象の栽培植物又は材料、気候条件や使用される特定の式(I)のウラシルピリジンなどの様々な因子に応じて決定される。

30

【0640】

式(I)のウラシルピリジン、そのN-オキシド、塩又は誘導体は、慣用の種類の農薬組成物、例えは液剤、エマルション剤、懸濁剤、粉剤、散剤、ペースト剤、粒剤、圧縮剤、カプセル剤及びそれらの混合物に変換することができる。農薬組成物タイプの例は、懸濁剤(例えはSC、OD、FS)、乳剤(例えはEC)、エマルション剤(例えはEW、EO、ES、ME)、カプセル剤(例えはCS、ZC)、ペースト剤、芳香剤(pastill)、水和散剤又は水和粉剤(wettable powder or dust)(例えはWP、SP、WS、DP、DS)、圧縮剤(例えはBR、TB、DT)、粒剤(例えはWG、SG、GR、FG、GG、MG)、殺虫製品(例えはLN)、並びに植物繁殖材料(例えは種子)の処理用のゲル製剤(例えはGF)である。これらの及びさらなる農薬組成物種は、「Catalogue of pesticide formulation types and international coding system」、Technical Monograph No. 2、第6版(2008年5月)、CropLife International中に定義されている。

40

【0641】

上記の農薬組成物は、Mollet及びGrubemannによりFormulation technology、Wiley VCH、Weinheim (2001年)に記載される方法;あるいはKnowlesによりNew develo

50

gments in crop protection product formulation, Agrow Reports DS243, T&F Informa, London (2005年)に記載される方法などの公知の方法で調製される。

【0642】

好適な助剤は、溶媒、液体担体、固体担体又は充填剤、界面活性剤、分散剤、乳化剤、湿潤剤、補助剤、可溶化剤、浸透促進剤、保護コロイド、粘着剤、増粘剤、保湿剤、忌避剤、誘引剤、摂食刺激材料、相溶化剤、殺細菌剤、凍結防止剤、消泡剤、着色剤、粘着付与剤及び結合剤である。

【0643】

好適な溶媒及び液体担体は、水及び有機溶媒(中～高沸点の鉱油画分(例えばケロセン、ディーゼルオイル)など);植物又は動物由来の油;脂肪族、環状及び芳香族炭化水素(例えば、トルエン、パラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化ナフタレン);アルコール(例えばエタノール、プロパノール、ブタノール、ベンジルアルコール、シクロヘキサンオール);グリコール;DMSO;ケトン(例えばシクロヘキサン);エステル(例えば乳酸エステル、炭酸エステル、脂肪酸エステル、ガンマ-ブチロラクトン);脂肪酸;ホスホネート;アミン;アミド(例えばN-メチルピロリドン、脂肪酸ジメチルアミド);及びそれらの混合物である。

10

【0644】

好適な固体担体又は充填剤は、鉱物質土類(例えばシリケート、シリカゲル、タルク、カオリナイト、石灰石、石灰、白亜、クレイ、ドロマイド、珪藻土、ベントナイト、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウム);多糖(例えばセルロース、デンプン);肥料(例えば硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素);植物起源の製品(例えば穀粉、樹皮粉、木粉、堅果殻粉)、及びそれらの混合物である。

20

【0645】

好適な界面活性剤は、界面活性化合物、例えばアニオン性界面活性剤、カチオン性界面活性剤、非イオン性界面活性剤及び両性界面活性剤、ブロックポリマー、高分子電解質、及びそれらの混合物である。このような界面活性剤は、乳化剤、分散剤、可溶化剤、湿潤剤、浸透促進剤、保護コロイド、又は補助剤として使用することができる。界面活性剤の例は、「McCutcheon's, 第1巻:Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock、米国、(2008年)(国際版又は北米版)」に挙げられている。

【0646】

好適なアニオン性界面活性剤は、スルホネート、スルフェート、ホスフェート、カルボキシレートのアルカリ塩、アルカリ土類塩又はアンモニウム塩、及びそれらの混合物である。スルホネートの例は、アルキルアリールスルホネート、ジフェニルスルホネート、アルファ-オレフィンスルホネート、リグニンスルホネート、脂肪酸及び油のスルホネート、エトキシリ化アルキルフェノールのスルホネート、アルコキシリ化アリールフェノールのスルホネート、縮合ナフタレンのスルホネート、ドデシルベンゼン及びトリデシルベンゼンのスルホネート、ナフタレン及びアルキルナフタレンのスルホネート、スルホスクシネート又はスルホスクシナメートである。スルフェートの例は、脂肪酸及び油のスルフェート、エトキシリ化アルキルフェノールのスルフェート、アルコールのスルフェート、エトキシリ化アルコールのスルフェート、又は脂肪酸エステルのスルフェートである。ホスフェートの例は、リン酸エステルである。カルボキシレートの例は、アルキルカルボキシレート、さらにカルボキシリ化アルコール又はアルキルフェノールエトキシリ化である。

30

【0647】

好適な非イオン性界面活性剤は、アルコキシレート、N-置換脂肪酸アミド、アミンオキシド、エステル、糖ベースの界面活性剤、ポリマー界面活性剤及びそれらの混合物である。アルコキシレートの例は、1～50当量アルコキシリ化されているアルコール、アルキルフェノール、アミン、アミド、アリールフェノール、脂肪酸又は脂肪酸エステルなどの化合物である。エチレンオキシド及び/又はプロピレンオキシド(好ましくはエチレンオキシド)をアルコキシリ化に用いることができる。N-置換脂肪酸アミドの例は、脂肪酸グルカミド又は脂肪酸アルカノールアミドである。エステルの例は、脂肪酸エステル、グリセロールエステル又はモノグリセリドである。糖ベースの界面活性剤の例は、ソルビタン、エト

40

50

キシリ化ソルビタン、スクロース及びグルコースエステル又はアルキルポリグルコシドである。ポリマー界面活性剤の例は、ビニルピロリドン、ビニルアルコール、又はビニルアセテートのホモポリマー又はコポリマーである。

【0648】

好適なカチオン性界面活性剤は、第四級界面活性剤、例えば、1個又は2個の疎水性基を有する第四級アンモニウム化合物、又は長鎖第一級アミンの塩である。好適な両性界面活性剤は、アルキルベタイン及びイミダゾリンである。好適なブロックポリマーは、ポリエチレンオキシドとポリプロピレンオキシドのブロックを含むA-B型又はA-B-A型のブロックポリマー、又はアルカノール、ポリエチレンオキシドとポリプロピレンオキシドを含むA-B-C型のブロックポリマーである。好適な高分子電解質は、ポリ酸又はポリ塩基である。ポリ酸の例は、ポリアクリル酸又はポリ酸型ポリマーのアルカリ塩である。ポリ塩基の例は、ポリビニルアミン又はポリエチレンアミンである。

10

【0649】

好適な補助剤は、それ自体の殺有害生物活性は無視し得るか、又はそれ自体は殺有害生物活性を有さず、標的にに対する式(I)のウラシルピリジンの生物学的性能を高める化合物である。例としては、界面活性剤、鉱物油又は植物油、及び他の助剤がある。さらなる例は、Knowlesにより、「Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, 第5章」に挙げられている。

【0650】

好適な増粘剤は、多糖(例えば、キサンタンガム、カルボキシメチルセルロース)、無機粘土(有機修飾粘土又は無修飾粘土)、ポリカルボキシレート及びシリケートである。

20

【0651】

好ましい殺細菌剤は、プロノポール及びイソチアゾリノン誘導体(例えばアルキルイソチアゾリノン及びベンズイソチアゾリノン)である。

【0652】

好適な凍結防止剤は、エチレングリコール、プロピレングリコール、尿素及びグリセリンである。

【0653】

好適な消泡剤は、シリコーン、長鎖アルコール及び脂肪酸の塩である。

【0654】

30

好適な着色剤(例えばレッド、ブルー、又はグリーンの着色剤)は、低水溶性の色素及び水溶性染料である。例としては、無機着色剤(例えば、酸化鉄、酸化チタン、ヘキサシアノ鉄酸鉄)及び有機着色剤(例えば、アリザリン着色剤、アゾ着色剤及びフタロシアニン着色剤)がある。

【0655】

好適な粘着付与剤又は結合剤は、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアセテート、ポリビニルアルコール、ポリアクリレート、生物学的ワックス又は合成ワックス、及びセルロースエーテルである。

【0656】

農薬組成物タイプ及びそれらの調製の例は以下のとおりである:

40

【0657】

i) 水溶性濃縮剤(water-soluble concentrates)(SL、LS)

10～60重量%の本発明による式(I)のウラシルピリジン、又は少なくとも1種の式(I)のウラシルピリジン(成分A)と除草化合物B(成分B)及び薬害軽減剤C(成分C)から選択される、少なくとも1種のさらなる化合物とを含む除草組成物、並びに5～15重量%の湿潤剤(例えばアルコールアルコキシレート)を100重量%までの水及び/又は水溶性溶媒(例えばアルコール)に溶解する。活性物質は水で希釈すると溶解する。

【0658】

ii) 分散性濃縮剤(dispersible concentrates)(DC)

5～25重量%の本発明による式(I)のウラシルピリジン、又は少なくとも1種の式(I)のウ

50

ラシリルピリジン(成分A)と除草化合物B(成分B)及び薬害軽減剤C(成分C)から選択される、少なくとも1種のさらなる化合物とを含む除草組成物、及び1~10重量%の分散剤(例えばポリビニルピロリドン)を、100重量%までの有機溶媒(例えばシクロヘキサン)に溶解する。水で希釈すると分散液が得られる。

【0659】

iii) 乳化性濃縮剤(emulsifiable concentrates)(EC)

15~70重量%の本発明による式(I)のウラシリルピリジン、又は少なくとも1種の式(I)のウラシリルピリジン(成分A)と除草化合物B(成分B)及び薬害軽減剤C(成分C)から選択される、少なくとも1種のさらなる化合物とを含む除草組成物、及び5~10重量%の乳化剤(例えばドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及びヒマシ油エトキシレート)を、100重量%までの非水溶性有機溶媒(例えば芳香族炭化水素)に溶解する。水で希釈するとエマルションが得られる。

10

【0660】

iv) エマルション剤(emulsions)(EW、EO、ES)

5~40重量%の本発明による式(I)のウラシリルピリジン、又は少なくとも1種の式(I)のウラシリルピリジン(成分A)と除草化合物B(成分B)及び薬害軽減剤C(成分C)から選択される、少なくとも1種のさらなる化合物とを含む除草組成物、及び1~10重量%の乳化剤(例えばドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムとヒマシ油エトキシレート)を、20~40重量%の非水溶性有機溶媒(例えば芳香族炭化水素)に溶解する。この混合物を、乳化装置を用いて100重量%までの水に導入し、均一なエマルションにする。水で希釈するとエマルションが得られる。

20

【0661】

v) 懸濁剤(suspensions)(SC、OD、FS)

攪拌下のボールミル内で、20~60重量%の、本発明による式(I)のウラシリルピリジン、又は少なくとも1種の式(I)のウラシリルピリジン(成分A)と除草化合物B(成分B)及び薬害軽減剤C(成分C)から選択される少なくとも1種のさらなる化合物とを含む除草組成物を、2~10重量%の分散剤及び湿潤剤(例えば、リグノスルホン酸ナトリウム及びアルコールエトキシレート)、0.1~2重量%の増粘剤(例えば、キサンタンガム)並びに100重量%までの水を加えながら粉碎し、活性物質の微細懸濁液を得る。水で希釈すると活性物質の安定な懸濁液が得られる。FSタイプの組成物には、40重量%までの結合剤(例えばポリビニルアルコール)を加える。

30

【0662】

vi) 水分散性粒剤(water-dispersible granules)及び水溶性粒剤(water-soluble granules)(WG、SG)

50~80重量%の、本発明による式(I)のウラシリルピリジン、又は少なくとも1種の式(I)のウラシリルピリジン(成分A)と除草化合物B(成分B)及び薬害軽減剤C(成分C)から選択される少なくとも1種のさらなる化合物とを含む除草組成物を、100重量%までの分散剤と湿潤剤(例えばリグノスルホン酸ナトリウムとアルコールエトキシレート)を加えながら微粉碎し、専用の装置(例えば、押出機、噴霧塔、流動床)を用いて水分散性粒剤又は水溶性粒剤として調製する。水で希釈すると活性物質の安定な分散液又は溶液が得られる。

40

【0663】

vii) 水分散性散剤(water-dispersible powders)及び水溶性散剤(water-soluble powders)(WP、SP、WS)

ローターステーターミル内で、50~80重量%の本発明による式(I)のウラシリルピリジン、又は少なくとも1種の式(I)のウラシリルピリジン(成分A)と除草化合物B(成分B)及び薬害軽減剤C(成分C)から選択される、少なくとも1種のさらなる化合物とを含む除草組成物を、1~5重量%の分散剤(例えば、リグノスルホン酸ナトリウム)、1~3重量%の湿潤剤(例えば、アルコールエトキシレート)及び100重量%までの固体担体(例えば、シリカゲル)を加えながら粉碎する。水で希釈すると活性物質の安定な分散液又は溶液が得られる。

【0664】

50

viii) ゲル剤(gel)(GW、GF)

攪拌下のボールミル内で、5～25重量%の、本発明による式(I)のウラシルピリジン、又は少なくとも1種の式(I)のウラシルピリジン(成分A)と除草化合物B(成分B)及び薬害軽減剤C(成分C)から選択される、少なくとも1種のさらなる化合物とを含む除草組成物を、3～10重量%の分散剤(例えばリグノスルホン酸ナトリウム)、1～5重量%の増粘剤(例えばカルボキシメチルセルロース)及び100重量%までの水を加えながら粉碎し、活性物質の微細懸濁液を得る。水で希釈すると活性物質の安定な懸濁液が得られる。

【0665】

iv) マイクロエマルション剤(microemulsion)(ME)

5～20重量%の本発明による式(I)のウラシルピリジン、又は少なくとも1種の式(I)のウラシルピリジン(成分A)と除草化合物B(成分B)及び薬害軽減剤C(成分C)から選択される、少なくとも1種のさらなる化合物とを含む除草組成物を、5～30重量%の有機溶媒ブレンド(例えば脂肪酸ジメチルアミド及びシクロヘキサン)、10～25重量%の界面活性剤ブレンド(例えばアルコールエトキシレート及びアリールフェノールエトキシレート)、及び100%までの水に加える。この混合物を1時間攪拌し、熱力学的に安定したマイクロエマルションを自然発生的に生成する。

【0666】

iv) マイクロカプセル剤(microcapsules)(CS)

5～50重量%の本発明による式(I)のウラシルピリジン、又は少なくとも1種の式(I)のウラシルピリジン(成分A)と除草化合物B(成分B)及び薬害軽減剤C(成分C)から選択される、少なくとも1種のさらなる化合物とを含む除草組成物、0～40重量%の非水溶性有機溶媒(例えば、芳香族炭化水素)、2～15重量%のアクリルモノマー(例えば、メチルメタクリレート、メタクリル酸及びジアクリレート又はトリアクリレート)を含む油相を、保護コロイド(例えば、ポリビニルアルコール)の水溶液中に分散させる。ラジカル開始剤によって開始されるラジカル重合は、ポリ(メタ)アクリレートマイクロカプセルの形成をもたらす。別法として、5～50重量%の本発明による式(I)のウラシルピリジン、0～40重量%の非水溶性有機溶媒(例えば、芳香族炭化水素)、及びイソシアネートモノマー(例えば、ジフェニルメテン-4,4'-ジイソシアネート)を含む油相を、保護コロイド(例えばポリビニルアルコール)の水溶液中に分散させる。ポリアミン(例えばヘキサメチレンジアミン)の添加は、ポリ尿素マイクロカプセルの形成をもたらす。モノマーは、総量1～10重量%になる。重量%は、総CS組成物に関する。

【0667】

ix) 散粉性散剤(dustable powders)(DP、DS)

1～10重量%の本発明による式(I)のウラシルピリジン、又は少なくとも1種の式(I)のウラシルピリジン(成分A)と除草化合物B(成分B)及び薬害軽減剤C(成分C)から選択される、少なくとも1種のさらなる化合物とを含む除草組成物を微粉碎し、100重量%までの固体担体(例えば微粉碎カオリン)と緊密に混合する。

【0668】

x) 粒剤(granules)(GR、FG)

0.5～30重量%の本発明による式(I)のウラシルピリジン、又は少なくとも1種の式(I)のウラシルピリジン(成分A)と除草化合物B(成分B)及び薬害軽減剤C(成分C)から選択される、少なくとも1種のさらなる化合物とを含む除草組成物を微粉碎し、100重量%までの固体担体(例えば、シリケート)と合わせる。顆粒化は、押出、噴霧乾燥、又は流動床によって達成される。

【0669】

xi) 超微量液剤(ultra-low volume liquids)(UL)

1～50重量%の本発明による式(I)のウラシルピリジン、又は少なくとも1種の式(I)のウラシルピリジン(成分A)と除草化合物B(成分B)及び薬害軽減剤C(成分C)から選択される、少なくとも1種のさらなる化合物とを含む除草組成物を、100重量%までの有機溶媒(例えば芳香族炭化水素)に溶解する。

10

20

30

40

50

【0670】

農薬組成物タイプi)~xi)は、場合によりさらなる助剤(例えば0.1~1重量%の殺細菌剤、5~15重量%の凍結防止剤、0.1~1重量%の消泡剤、及び0.1~1重量%の着色剤)を含み得る。

【0671】

農薬組成物及び/又は除草組成物は、一般的に、0.01~95重量%、好ましくは0.1~90重量%、特に0.5~75重量%の式(I)のウラシルピリジンを含む。式(I)のウラシルピリジンは、90%~100%、好ましくは95%~100%の純度(NMRスペクトルによる)で用いられる。

【0672】

種子処理用溶液剤(LS)、サスペンション剤(suspension)(SE)、フロアブル濃縮剤(flowable concentrate)(FS)、乾燥処理用散剤(DS)、スラリー処理用分散性散剤(W S)、水溶性散剤(SS)、エマルション剤(ES)、乳剤(EC)及びゲル剤(GF)は、通常、植物繁殖材料(特に種子)の処理の目的のために用いられる。本農薬組成物は、2~10倍希釈後、即時使用可能調製物において、0.01~60重量%、好ましくは0.1~40重量%の活性物質濃度を与える。施用は、播種前又は播種中に行うことができる。

10

【0673】

式(I)のウラシルピリジン、その農薬組成物及び/又は除草組成物を、植物繁殖材料(とりわけ種子)に施用するための方法は、繁殖材料の粉衣法(dressing)、コーティング法(coating)、ペレッティング法(pelleting)、散粉法(dusting)、浸漬法(soaking)及び畝間施用法(in-furrow)を含む。好ましくは、式(I)のウラシルピリジン、その農薬組成物及び/又は除草組成物は、それぞれ、発芽が誘導されないような方法で(例えば種子粉衣法、種子ペレッティング法、種子コーティング法、及び種子散粉法によって)植物繁殖材料に施用される。

20

【0674】

様々な種類の油、湿潤剤、補助剤、肥料、又は微量栄養素、及びさらなる殺有害生物剤(例えば除草剤、殺虫剤、殺菌剤、成長調節剤、薬害軽減剤)を、式(I)のウラシルピリジン、農薬組成物及び/又は除草組成物に、プレミックスとして、又は適切であれば使用直前に添加することができる(タンクミックス)。これらの薬剤は、本発明による農薬組成物と、1:100~100:1、好ましくは1:10~10:1の重量比で混合することができる。

30

【0675】

使用者は、本発明による式(I)のウラシルピリジン、それを含む農薬組成物及び除草組成物を、通常、事前に投与量を設定できる(pre-dosage)デバイス、背負い式噴霧器、噴霧タンク、噴霧飛行機、又は灌漑システムから施用する。通常、本農薬組成物は、水、緩衝剤、及び/又はさらなる助剤により所望の施用濃度とされ、このようにして本発明による即時使用可能噴霧液又は農薬組成物が得られる。通常、農業有用面積1ヘクタール当たり20~2000リットル、好ましくは50~400リットルの即時使用可能噴霧液が施用される。

30

【0676】

一実施形態によれば、本発明による農薬組成物の個々の成分、又は部分的にプレミックスされた成分のいずれか、例えば、式(I)のウラシルピリジン、並びに場合により群B及び/又はC)からの活性物質を含む成分は、使用者がスプレータンク内で混合してもよく、適切であれば、さらなる助剤及び添加剤を添加してもよい。

40

【0677】

さらなる実施形態において、本発明による農薬組成物の個々の成分(例えばキットの一部又は二成分若しくは三成分混合物の一部)は、使用者自身がスプレータンク内で混合してもよく、適切であれば、さらなる助剤を添加してもよい。

【0678】

さらなる実施形態において、本発明による農薬組成物の個々の成分、又は部分的にプレミックスされた成分のいずれか、例えば、式(I)のウラシルピリジン、並びに場合により群B及び/又はC)からの活性物質を含む成分は、共に(例えば、タンク混合後)又は連続的に施用することができる。

50

【0679】

式(I)のウラシルピリジンは、除草剤として好適である。これらは、それ自体で、適切に配合された組成物(農薬組成物)として、又は除草活性化合物B(成分B)及び薬害軽減剤C(成分C)から選択される少なくとも1種のさらなる化合物と組み合わせた除草組成物として好適である。

【0680】

式(I)のウラシルピリジン、又は式(I)のウラシルピリジンを含む農薬組成物及び/若しくは除草組成物は、とりわけ高施用量で非常に効率的に非作物区域の植生を防除する。これらは、コムギ、イネ、トウモロコシ、ダイズ及びワタなどの作物における広葉雑草及びイネ科雑草に対して、作物植物に著しい損傷をもたらすことなく作用する。この効果は、主に低施用量で観察される。

10

【0681】

式(I)のウラシルピリジン、又はそれを含む農薬組成物及び/若しくは除草組成物は、主に葉に噴霧することによって、植物に施用される。ここで、施用は、例えば水を担体として使用し、約100～1000l/ha(例えば300～400l/ha)の噴霧液量を用いる慣用の噴霧技術によって行うことができる。式(I)のウラシルピリジン、又はそれを含む農薬組成物及び/若しくは除草組成物はまた、低量法若しくは超低量法により、又は微顆粒の形態で施用することもできる。

【0682】

式(I)のウラシルピリジン、又はそれを含む農薬組成物及び/若しくは除草組成物の施用は、望ましくない植物の出芽前、出芽中及び/又は出芽後、好ましくは出芽中及び/又は出芽後に行うことができる。

20

【0683】

式(I)のウラシルピリジン、又はそれを含む農薬組成物及び/若しくは除草組成物は、出芽前、出芽後、若しくは植え付け前、又は作物植物の種子と一緒に施用することができる。作物植物の、式(I)のウラシルピリジン、又はそれを含む農薬組成物及び/若しくは除草組成物を用いて前処理した種子を適用することにより、式(I)のウラシルピリジン、又はそれを含む農薬組成物及び/若しくは除草組成物を施用することも可能である。活性成分が特定の作物植物に十分に耐容されない場合には、噴霧装置を利用して、上記活性成分が、作物植物の下で生育している望ましくない植物の葉又は露地の土壤表面には到達するが、感受性の高い作物植物の葉には可能な限り接触しないような方法で除草組成物が噴霧される施用技術を使用し得る(ポストディレクテッド(post-directed)、レイバイ(lay-by))。

30

【0684】

さらなる実施形態において、式(I)のウラシルピリジン、又はそれを含む農薬組成物及び/若しくは除草組成物は、種子を処理することによって施用することができる。種子の処理は、式(I)のウラシルピリジン、又はそれから調製される農薬組成物及び/若しくは除草組成物をベースとする、当業者によく知られている本質的に全ての方法(種子粉衣法、種子コーティング法、種子散粉法、種子浸漬法、種子フィルムコーティング法、種子多層コーティング法、種子外皮被覆法、種子滴下法、及び種子ペレット化法)を含む。ここで、除草組成物は、希釈して又は希釈せずに施用することができる。

40

【0685】

用語「種子」は、例えば穀粒、種子、果実、塊茎、実生及び類似形態などのあらゆるタイプの種子を含む。ここで、好ましくは用語「種子」は、穀粒及び種子を表す。使用される種子は、上記の有用植物の種子であり得るが、またトランスジェニック植物又は慣用の育種法によって得られた植物の種子でもあり得る。

【0686】

植物保護に用いられる場合、配合助剤を含まない、施用される活性物質(すなわち式(I)のウラシルピリジン、成分B及び適切であれば、成分C)の量は、所望の効果の種類に応じて、1ha当たり0.001～2kg、好ましくは1ha当たり0.005～2kg、より好ましくは1ha当たり0.05～1.5kg、特に1ha当たり0.1～1kgである。

50

【0687】

本発明の別の実施形態において、式(I)のウラシルピリジン、成分B及び適切であれば、成分Cの施用量は、活性物質(a.s.)0.001～3kg/ha、好ましくは0.005～2.5kg/ha、また特に0.01～2kg/haである。

【0688】

本発明の別の好ましい実施形態において、本発明による式(I)のウラシルピリジンの施用量(式(I)のウラシルピリジンの総量)は、防除標的、季節、標的植物及び生育段階に応じて、0.1g/ha～3000g/ha、好ましくは1g/ha～1000g/haである。

【0689】

本発明の別の好ましい実施形態において、式(I)のウラシルピリジンの施用量は、0.1g/ha～5000g/haの範囲、また好ましくは0.5g/ha～2500g/ha、又は2.5g/ha～2000g/haの範囲である。

【0690】

本発明の別の好ましい実施形態において、式(I)のウラシルピリジンの施用量は、0.1～1000g/ha、好ましくは0.5～750g/ha、より好ましくは2.5～500g/haである。

【0691】

除草化合物Bの所要の施用量は、一般的に、活性物質(a.s.)0.0005kg/ha～2.5kg/haの範囲、好ましくは0.005kg/ha～2kg/ha、又は0.01kg/ha～1.5kg/haの範囲である。

【0692】

薬害軽減剤Cの所要の施用量は、一般的に、活性物質(a.s.)0.0005kg/ha～2.5kg/haの範囲、また好ましくは0.005kg/ha～2kg/ha、又は0.01kg/ha～1.5kg/haの範囲である。

【0693】

例えば散粉、コーティング、又は灌注(drenching)による植物繁殖材料(例えば種子)の処理において、植物繁殖材料(好ましくは種子)100キログラム当たり0.1～1000g、好ましくは1～1000g、より好ましくは1～100g、また最も好ましくは5～100gの活性物質の量が一般的に必要とされる。

【0694】

本発明の別の実施形態において、種子を処理するために、施用される活性物質(すなわち、式(I)のウラシルピリジン、成分B及び適切であれば、成分C)の量は、一般的に種子100kg当たり0.001～10kgの量で利用される。

【0695】

材料又は貯蔵製品の保護に用いられる場合、施用される活性物質の量は、施用区域の種類及び所望の効果に応じて決定される。材料の保護において慣用的に施用される量は、処理対象の材料1立方メートル当たり活性物質0.001g～2kg、好ましくは0.005g～1kgである。

【0696】

本発明による除草組成物の場合、式(I)のウラシルピリジン、並びにさらなる成分B及び/又は成分Cを、一緒に配合して施用するか又は別々に配合して施用するかは重要ではない。

【0697】

個別施用の場合、施用がどの順番で行われるかはあまり重要ではない。活性成分の植物に対する同時作用を可能とする時間枠で(好ましくは最大14日間、特に最大7日間の時間枠内で)、式(I)のウラシルピリジン、並びにさらなる成分B及び/又は成分Cが施用されることのみが必要とされる。

【0698】

当該施用方法に応じて、式(I)のウラシルピリジン、又はそれを含む農薬組成物及び/若しくは除草組成物は、さらに多数の作物植物における望ましくない植物を除去するために付加的に用いることができる。好適な作物の例は以下のとおりである：

タマネギ(Allium cepa)、パインアップル(Ananas comosus)、ピーナツ(Arachis hypogaea)、アスパラガス(Asparagus officinalis)、マカラスムギ(Avena sativa)、サトウ

10

20

30

40

50

ダイコンのアルチッシマ種(*Beta vulgaris* spec. *altissima*)、サトウダイコンのラバ種(*Beta vulgaris* spec. *rapa*)、セイヨウアブラナのナパス変種(*Brassica napus* var. *napus*)、ルタバガ(*Brassica napus* var. *napobrassica*)、ブラッシカ・ラバのシルベストリス変種(*Brassica rapa* var. *silves*トリス)、ブラッシカ・オレラセア(*Brassica oleracea*)、クロガラシ(*Brassica nigra*)、チャノキ(*Camellia sinensis*)、ベニバナ(*Carthamus tinctorius*)、ペカン(*Carya illinoinensis*)、レモン(*Citrus limon*)、オレンジ(*Citrus sinensis*)、コーヒーノキ(*Coffea arabica*) (ロブスタコーヒーノキ(*Coffea canephora*)、リベリカコーヒーノキ(*Coffea liberica*))、キュウリ(*Cucumis sativus*)、ギョウギシバ(*Cynodon dactylon*)、ニンジン(*Daucus carota*)、ギニアアブラヤシ(*Elaeis guineensis*)、エゾヘビイチゴ(*Fragaria vesca*)、ダイズ(*Glycine max*)、ワタ(*Gossypium hirsutum*)、(モクメン(*Gossypium arboreum*)、シロバナワタ(*Gossypium herbaceum*)、ベニバナワタ(*Gossypium vitifolium*))、ヒマワリ(*Helianthus annuus*)、パラゴムノキ(*Hevea brasiliensis*)、オオムギ(*Hordeum vulgare*)、ホップ(*Humulus lupulus*)、サツマイモ(*Ipomoea batatas*)、シナノグルミ(*Juglans regia*)、レンズマメ(*Lens culinaris*)、アマ(*Linum usitatissimum*)、トマト(*Lycopersicon lycopersicum*)、リンゴ属の種(*Malus* spec.)、キヤッサバ(*Manihot esculenta*)、アルファルファ(*Medicago sativa*)、バショウ属の種(*Musa* spec.)、タバコ(*Nicotiana tabacum*) (ニコティアナ・ルスティカ(*N.rustica*))、オリーブ(*Olea europaea*)、イネ(*Oryza sativa*)、ライマメ(*Phaseolus lunatus*)、インゲンマメ(*Phaseolus vulgaris*)、オウシュウトウヒ(*Picea abies*)、マツ属の種(*Pinus* spec.)、ピスタシア・ヴェラ(*Pistacia vera*)、エンドウマメ(*Pisum sativum*)、セイヨウミザクラ(*Prunus avium*)、モモ(*Prunus persica*)、セイヨウナシ(*Pyrus communis*)、アンズ(*Prunus armeniaca*)、スミノミザクラ(*Prunus cerasus*)、アーモンド(*Prunus dulcis*)及び西洋スモモ(*prunus domestica*)、スグリ(*Ribes sylvestre*)、トウゴマ(*Ricinus communis*)、サトウキビ(*Saccharum officinarum*)、ライムギ(*Secale cereale*)、シロガラシ(*Sinapis alba*)、ジャガイモ(*Solanum tuberosum*)、ソルガム(*Sorghum bicolor*) (モロコシ(*s.vulgare*))、カカオ(*Theobroma cacao*)、アカツメクサ(*Trifolium pratense*)、コムギ(*Triticum aestivum*)、ライコムギ(*Triticale*)、デュラムコムギ(*Triticum durum*)、ソラマメ(*Vicia faba*)、ブドウ(*Vitis vinifera*)、及びトウモロコシ(*Zea mays*)。

【0699】

好ましい作物は、ピーナツ(*Arachis hypogaea*)、サトウダイコンのアルチッシマ種(*Beta vulgaris* spec. *altissima*)、セイヨウアブラナのナパス変種(*Brassica napus* var. *napus*)、ブラッシカ・オレラセア(*Brassica oleracea*)、レモン(*Citrus limon*)、オレンジ(*Citrus sinensis*)、コーヒーノキ(*Coffea arabica*) (ロブスタコーヒーノキ(*Coffea canephora*)、リベリカコーヒーノキ(*Coffea liberica*))、ギョウギシバ(*Cynodon dactylon*)、ダイズ(*Glycine max*)、ワタ(*Gossypium hirsutum*) (モクメン(*Gossypium arboreum*)、シロバナワタ(*Gossypium herbaceum*)、ベニバナワタ(*Gossypium vitifolium*))、ヒマワリ(*Helianthus annuus*)、オオムギ(*Hordeum vulgare*)、シナノグルミ(*Juglans regia*)、レンズマメ(*Lens culinaris*)、アマ(*Linum usitatissimum*)、トマト(*Lycopersicon lycopersicum*)、リンゴ属の種(*Malus* spec.)、アルファルファ(*Medicago sativa*)、タバコ(*Nicotiana tabacum*) (ニコティアナ・ルスティカ(*N.rustica*))、オリーブ(*Olea europaea*)、イネ(*Oryza sativa*)、ライマメ(*Phaseolus lunatus*)、インゲンマメ(*Phaseolus vulgaris*)、ピスタシア・ヴェラ(*Pistacia vera*)、エンドウマメ(*Pisum sativum*)、アーモンド(*Prunus dulcis*)、サトウキビ(*Saccharum officinarum*)、ライムギ(*Secale cereale*)、ジャガイモ(*Solanum tuberosum*)、ソルガム(*Sorghum bicolor*) (モロコシ(*s.vulgare*))、ライコムギ(*Triticale*)、コムギ(*Triticum aestivum*)、デュラムコムギ(*Triticum durum*)、ソラマメ(*Vicia faba*)、ブドウ(*Vitis vinifera*)及びトウモロコシ(*Zea mays*)である。

【0700】

とりわけ好ましい作物は、穀物、トウモロコシ、ダイズ、イネ、アブラナ、ワタ、ジャ

10

20

30

40

50

ガイモ、ピーナツ、又は樹園作物の作物である。

【0701】

本発明による式(I)のウラシルピリジン、又はそれを含む農薬組成物及び/若しくは除草組成物はまた、遺伝子改変植物において用いることもできる。用語「遺伝子改変植物」は、その遺伝物質が、組換えDNA技術の使用によって、その植物種のゲノムが生来有さないDNAの挿入配列を含むか、又はその種のゲノムが生来有していたDNAの欠失を示すように改変されている植物であって、上記改変(1つ又は複数)が、交雑育種、突然変異誘発又は天然の組換えのみによっては容易に得ることができない、上記植物として理解される。多くの場合、特定の遺伝子改変植物は、組換えDNA技術の使用によりゲノムが直接処理された祖先植物から、天然の交雑又は繁殖の過程を介して遺伝によりその遺伝子改変(1つ又は複数)を得た植物であろう。典型的には、植物の特定の特性を改善するために、1つ以上の遺伝子が遺伝子改変植物の遺伝物質中に組み込まれている。このような遺伝子改変として、タンパク質(1つ又は複数)、オリゴペプチド又はポリペプチドの標的化翻訳後修飾(例えば、これらの中にプレニル化、アセチル化、ファルネシル化又はPEG部分の付加などのグリコシル化又はポリマー付加を可能とし、低下又は促進させるアミノ酸変異(1つ又は複数)を包含することによる)も挙げられるが、これらに限定されるものではない。

10

【0702】

育種、突然変異誘発又は遺伝子操作によって改変された植物は、例えば、育種又は遺伝子操作の通常の方法の結果として、オーキシン除草剤(例えばジカンバ若しくは2,4-D)、白化除草剤(例えばヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)阻害剤若しくはフィトエンデサチュラーゼ(PDS)阻害剤)、アセト乳酸シナーゼ(ALS)阻害剤(例えばスルホニル尿素若しくはイミダゾリノン)、エノールピルビニルシキミ酸3-リン酸シナーゼ(EPSP)阻害剤(例えばグリホサート)、グルタミンシンターゼ(GS)阻害剤、プロトポルフィリノーゲン-IXオキシダーゼ阻害剤(例えばグルホシネート)、脂質合成阻害剤(例えばアセチルCoAカルボキシラーゼ(ACCase)阻害剤)、又はオキシニル(oxynil)(すなわち、プロモキシニル又はアイオキシニル)除草剤などの特定のクラスの除草剤の施用に対して耐性となっている。さらに、植物は、複数の遺伝子改変を介して複数のクラスの除草剤に対して抵抗性となっており、このような抵抗性は、例えば、グリホサートとグルホシネートの両方に対する抵抗性、又はグリホサートとALS阻害剤、HPPD阻害剤、オーキシン除草剤若しくはACCase阻害剤など別のクラスの除草剤との両方に対する抵抗性などである。これらの除草剤抵抗性技術は、例えば、Pest Management Science、61、2005, 246; 61、2005, 258; 61、2005, 277; 61、2005, 269; 61、2005, 286; 64、2008, 326; 64、2008, 332; Weed Science、57, 2009, 108; Australian Journal of Agricultural Research 58, 2007, 708; Science 316、2007, 1185; 及びこれらの文献中で引用されている参考文献に記載されている。いくつかの栽培植物は、突然変異誘発及び従来の育種法により除草剤に対して耐性となっており、例えば、イミダゾリノン系(例えばイマザモックス)に対して耐性であるClearfield(登録商標)夏ナタネ(Canola, BASF SE、ドイツ)、又はスルホニル尿素(例えばトリベニュロン)に対して耐性であるExpressSun(登録商標)ヒマワリ(DuPont、USA)がある。遺伝子操作方法を用いて、ダイズ、ワタ、トウモロコシ、ビーツ及びナタネなどの栽培植物が、グリホサート、イミダゾリノン及びグルホシネートなどの除草剤に対して耐性となっており、これらの一部は開発中であるか、又はRoundupReady(登録商標)(グリホサート耐性、Monsanto、USA)、Cultivance(登録商標)(イミダゾリノン耐性、BASF SE、ドイツ)及びLibertyLink(登録商標)(グルホシネート耐性、Bayer CropScience、ドイツ)というブランド若しくは商品名で市販されている。

20

【0703】

さらに、組換えDNA技術の使用により、1種以上の殺虫タンパク質、とりわけバチルス属細菌(Bacillus)由来(特にバチルス・チューリングエンシス(Bacillus thuringiensis)由来)の公知の殺虫タンパク質、例えばデルタ-エンドトキシン(例えば、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIF、CryIF(a2)、CryIIA(b)、CryIIIA、CryIIB(b1)又はCry9c);植物性殺虫タンパク質(VIP)(例えばVIP1、VIP2、VIP3又はVIP3A);細菌コロニー形成線虫(例えばフォ

30

40

50

トラブダス属の種(*Photorhabdus spp.*)又はゼノラブダス属の種(*Xenorhabdus spp.*)の殺虫タンパク質;動物によって產生される毒素(例えばサソリ毒素、クモ毒素、スズメバチ毒素若しくは他の昆虫特異的神經毒);真菌によって產生される毒素(例えばストレプトマイセス(*Streptomyces*)毒素);植物レクチン(例えばエンドウマメレクチン又はオオムギレクチン);アグルチニン;プロテイナーゼ阻害剤(例えばトリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン又はパパイン阻害剤);リボソーム不活性化タンパク質(RIP)(例えばリシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフィン、サポリン又はブリオジン);ステロイド代謝酵素(例えば3-ヒドロキシ-ステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-ID P-グリコシル-トランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン阻害剤又はHMG-CoA-レダクターゼ);イオンチャネル遮断薬(例えばナトリウムチャネル又はカルシウムチャネルの遮断薬);幼若ホルモンエステラーゼ;利尿ホルモン受容体(ヘリコキニン受容体);スチルベンシンターゼ、ビベンジルシンターゼ、キチナーゼ又はグルカナーゼを合成することができる植物も含まれる。本発明の文脈において、これらの殺虫タンパク質又は毒素は、前毒素、ハイブリッドタンパク質、短縮型又はその他の点で改変されたタンパク質を含むものとしても明確に理解される。ハイブリッドタンパク質は、タンパク質ドメインの新たな組合せによって特徴付けられる(例えばWO 02/015701を参照)。このような毒素、又はこのような毒素を合成することができる遺伝子改変植物のさらなる例は、例えばEP-A 374 753、WO 93/007278、WO 95/34656、EP-A 427 529、EP-A 451 878、WO 03/18810及びWO 03/52073に開示されている。このような遺伝子改変植物を作出する方法は、当業者に一般的に公知であり、例えば、上記の刊行物に記載されている。遺伝子改変植物中に含まれるこれらの殺虫タンパク質は、これらのタンパク質を產生する植物に、節足動物の全ての分類群に由来する有害生物、とりわけ甲虫類(甲虫目(Coeloptera)、双翅昆虫類(双翅目(Diptera))、及び蛾類(鱗翅類(Lepidoptera))並びに線虫(線虫類(Nematoda))に対する耐性を与える。1種以上の殺虫タンパク質を合成することができる遺伝子改変植物は、例えば上記の刊行物に記載されており、これらの一部は市販されており、例えば、YieldGard(登録商標)(Cry1Ab毒素を產生するトウモロコシ品種)、YieldGard(登録商標)Plus(Cry1Ab及びCry3Bb1毒素を產生するトウモロコシ品種)、Starlink(登録商標)(Cry9c毒素を產生するトウモロコシ品種)、Herculex(登録商標)RW(Cry34Ab1、Cry35Ab1及び酵素ホスフィノトリシン-N-アセチルトランスフェラーゼ(PAT)を產生するトウモロコシ品種);NuCOTN(登録商標)33B(Cry1Ac毒素を產生するワタ品種)、Bollgard(登録商標)I(Cry1Ac毒素を產生するワタ品種)、Bollgard(登録商標)II(Cry1Ac及びCry2Ab2毒素を產生するワタ品種);VIPCOT(登録商標)(VIP毒素を產生するワタ品種);NewLeaf(登録商標)(Cry3A毒素を產生するジャガイモ品種);Bt-Xtra(登録商標)、Nature Gard(登録商標)、KnockOut(登録商標)、BiteGard(登録商標)、Protecta(登録商標)、Bt 11(例えばAgrisure(登録商標)CB)及びSyngenta Seeds SAS(フランス製)のBt176(Cry1Ab毒素及びPAT酵素を產生するトウモロコシ品種)、Syngenta Seeds SAS(フランス製)のMIR604(改変型のCry3A毒素を產生するトウモロコシ品種、WO 03/018810を参照)、Monsanto Europe S.A.(ベルギー)製のMON 863(Cry3Bb1毒素を產生するトウモロコシ品種)、Monsanto Europe S.A.、ベルギーからのIPC 531(改変型のCry1Ac毒素を產生するワタ品種)、並びにPioneer Overseas Corporation(ベルギー製)の1507(Cry1F毒素及びPAT酵素を產生するトウモロコシ品種)がある。

【0704】

さらに、組換えDNA技術の使用により、1種以上のタンパク質を合成して細菌、ウイルス又は菌類の病原体に対するこれらの植物の抵抗性又は耐性を増加させることができる植物も含まれる。このようなタンパク質の例は、いわゆる「病原性関連タンパク質」(PRタンパク質、例えばEP-A 392 225を参照)、植物病害抵抗性遺伝子(例えば、メキシコの野生ジャガイモであるソラヌム・ブルボカスタヌム(*Solanum bulbocastanum*)に由来する、フィトフトラ・インフェスタンス(*Phytophthora infestans*)に対して作用する抵抗性遺伝子を発現するジャガイモ品種)又はT4-リゾチーム(例えば、エルウィニア・アミロボラ(*Erwinia amylovora*)などの細菌に対して増加した抵抗性を有するこれらのタンパク質

10

20

30

40

50

を合成することができるジャガイモ品種)である。このような遺伝子改変植物を作出する方法は当業者に一般的に公知であり、例えば上記の刊行物に記載されている。

【0705】

さらに、組換えDNA技術の使用により、これらの植物の生産性(例えば、バイオマス生産、穀物収量、デンプン含有量、含油量若しくはタンパク質含有量)、干ばつ、塩分若しくは他の生育制限環境因子に対する耐性、又は有害生物及び真菌性、細菌性若しくはウイルス性の病原体に対する耐性を増加させる1種以上のタンパク質を合成することができる植物も包含される。

【0706】

さらに、組換えDNA技術の使用により、特にヒト又は動物の栄養を改善するために改変量の成分又は新たな成分を含有する植物も包含され、例えば、健康を促進する長鎖オメガ-3脂肪酸又は不飽和オメガ-9脂肪酸を産生する油料作物(例えば、Nexera(登録商標)ナタネ、Dow AgroSciences、カナダ)がある。

10

【0707】

さらに、組換えDNA技術の使用により、特に原料生産を改善するために改変量の成分又は新たな成分を含有する植物も包含され、例えば、増加量のアミロペクチンを産生するジャガイモ(例えば、Amflora(登録商標)ジャガイモ、BASF SE、ドイツ)がある。

【0708】

さらに、本発明による式(I)のウラシルピリジン、又はそれを含む農薬組成物及び/若しくは除草組成物はまた、植物部分の落葉及び/又は乾燥に適していることも見出されているが、これには、作物植物、例えば、ワタ、ジャガイモ、アブラナ、ヒマワリ、ダイズ、ソラマメ、穀物(例えば、コムギ、オオムギ、サトウモロコシ、キビ、オートムギ、ライムギ及びライコムギ)、トウモロコシ及びレンズマメ、好ましくは、ワタ、ジャガイモ、アブラナ、ヒマワリ、ダイズ又はソラマメ、特にワタが適している。これに関しては、植物の乾燥及び/又は落葉のための農薬組成物及び/又は除草組成物、これらの農薬組成物及び/又は除草組成物の調製方法、並びに式(I)のウラシルピリジンを用いる植物を乾燥及び/又は落葉させるための方法が見出されている。

20

【0709】

乾燥剤として、式(I)のウラシルピリジンは、特に、ジャガイモ、アブラナ、ヒマワリ及びダイズなどの作物植物の地上部のみではなく、穀類(例えば、コムギ、オオムギ、サトウモロコシ、キビ、オートムギ、ライムギ及びライコムギ)、トウモロコシ及びレンズマメの地上部をも乾燥させるのに適している。これは、これらの重要な作物植物の完全機械収穫を可能とする。

30

【0710】

また経済的利益があるのは収穫の簡易化であり、それは、柑橘類果実、オリーブ及び他の種、並びに様々な有害(pernicious)な果実、核果及び堅果において、裂開、又は木への着生の低減を特定の期間内に集中させることによって可能となる。同じ機構、すなわち、植物の果実部又は葉部と苗条部との間の脱離組織の発達の促進はまた、有用植物(特にワタ)の落葉の制御に不可欠である。

【0711】

40

さらに、個々のワタ植物の成熟の時間間隔の短縮は、収穫後の纖維品質の向上につながる。

【0712】

さらに、式(I)のウラシルピリジン、又は式(I)のウラシルピリジンを含む農薬組成物及び/又は除草組成物はまた、PPO耐性雑草を非常に効果的に防除することも見出されている。

【0713】

従って、本発明はまた、PPO耐性雑草の成長を防除するための方法であって、このような雑草、その部分、その繁殖材料又はその生息地に、式(I)のウラシルピリジンを接触させるステップを含み、PPO耐性雑草が、式(I)のウラシルピリジンを除くPPO阻害性除草剤に耐性がある雑草である、方法を提供する。

50

【0714】

本発明は特に、作物におけるPPO耐性雑草を防除する方法であって、前記PPO除草剤耐性雑草が発生している、又は発生する恐れのある作物に式(I)のウラシルピリジンを施用するステップを含む、方法に関する。

【0715】

本明細書で使用する場合、用語「PPO阻害剤」、「PPO阻害剤除草剤」、「PPO阻害性除草剤」、「プロトポルフィリノーゲンIXオキシダーゼ阻害剤除草剤」、「プロトポルフィリノーゲンIXオキシダーゼ阻害性除草剤」、「プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼ阻害剤除草剤」及び「プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼ阻害性除草剤」は、同義語であり、植物の酵素であるプロトポルフィリノーゲンオキシダーゼを阻害する除草剤を指す。

10

【0716】

本明細書で使用する場合、用語「PPO阻害剤除草剤耐性雑草」、「PPO阻害性除草剤耐性雑草」、「PPO阻害剤耐性雑草」、「PPO耐性雑草」、「プロトポルフィリノーゲンIXオキシダーゼ阻害剤除草剤耐性雑草」、「プロトポルフィリノーゲンIXオキシダーゼ阻害性除草剤耐性雑草」、「プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼ阻害剤除草剤耐性雑草」及び「プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼ阻害性除草剤耐性雑草」は、同義語であり、PPO阻害性除草剤の適切な又は適切な施用量以上により処理することに関連して、

(1)野生型雑草に致死的(すなわち、根絶する)である場合に、そうした処理にも生き残る、又は

20

(2)野生型雑草の成長を抑制する場合でも、処理後にかなりの植生成長又は繁殖を示す能力を遺伝的に引き継いだ、進化した又は後天的に獲得した植物を指す。

【0717】

有効な雑草防除とは、処理の2週間後に決定すると、作物から少なくとも70%の雑草抑制若しくは根絶として、又は少なくとも70%の雑草植物毒性として定義される。

【0718】

従って、PPO耐性雑草は、式(I)のウラシルピリジンを除くPPO阻害剤の施用により防除されない雑草である一方、個々の感受性バイオタイプはその使用量で防除される。

【0719】

ここで、「防除されない」とは、目視による評点において、雑草防除(除草作用)が、処理の2週間後に決定すると、70%の雑草抑制又は根絶となることを意味し、「防除された」とは、目視による評点において、雑草防除が、処理の2週間後に決定すると、90%の雑草抑制又は根絶となることを意味する。

30

【0720】

好ましくは、PPO耐性雑草は、式(I)のウラシルピリジンを除く、PPO阻害性除草剤の施用により、防除されなかった(すなわち、処理の2週間後に決定すると、目視による評点において、雑草防除が70%の雑草抑制又は根絶となる)雑草である。

【0721】

同様に好ましくは、PPO耐性雑草は、アザフェニンから選択されるPPO阻害性除草剤の施用により、防除されなかった(すなわち、処理の2週間後に決定すると、目視による評点において、雑草防除が70%の雑草抑制又は根絶となる)雑草である。

40

【0722】

同様に好ましくは、PPO耐性雑草は、アザフェニン、ホメサフェン及びラクトフェンから選択されるPPO阻害性除草剤の施用により、防除されなかった(すなわち、処理の2週間後に決定すると、目視による評点において、雑草防除が70%の雑草抑制又は根絶となる)雑草である。

【0723】

同様に好ましくは、PPO耐性雑草は、ホメサフェン及びラクトフェンから選択されるPPO阻害性除草剤の施用により、防除されなかった(すなわち、処理の2週間後に決定すると、目視による評点において、雑草防除が70%の雑草抑制又は根絶となる)雑草である。

50

【0724】

同様に、好ましくは、PPO耐性雑草は、アシフルオルフェン、アザフェニジン、カルフェントラゾン、フルミクロラック、フルミオキサジン、ホメサフェン、ラクトフェン、オキサジアゾン、オキシフルオルフェン、ピラフルフェン及びスルフェントラゾンから選択されるPPO阻害性除草剤の施用により、防除されなかった(すなわち、処理の2週間後に決定すると、目視による評点において、雑草防除が 70%の雑草抑制又は根絶となる)雑草である。

【0725】

同様に好ましくは、PPO耐性雑草は、アシフルオルフェン、カルフェントラゾン、フルミクロラック、フルミオキサジン、ホメサフェン、ラクトフェン、オキサジアゾン、オキシフルオルフェン、ピラフルフェン及びスルフェントラゾンから選択されるPPO阻害性除草剤の施用により、防除されなかった(すなわち、処理の2週間後に決定すると、目視による評点において、雑草防除が 70%の雑草抑制又は根絶となる)雑草である。

10

【0726】

同様に好ましくは、PPO耐性雑草は、
200g/ha以下、
特に好ましくは、100g/ha以下、
とりわけ好ましくは、50~200g/ha、
より好ましくは、50~100g/ha
の施用量の、式(I)のウラシルピリジンを除くPPO阻害性除草剤により防除されなかった(すなわち、処理の2週間後に決定すると、目視による評点において、雑草防除が 70%の雑草抑制又は根絶となる)雑草である一方、個々の感受性バイオタイプは、その使用量では防除されない(すなわち、目視による評点において、処理の2週間後に決定すると、雑草防除が 90%の雑草抑制又は根絶となる)。

20

【0727】

同様に好ましくは、PPO耐性雑草は、
200g/ha以下、
特に好ましくは、100g/ha以下、
とりわけ好ましくは、50~200g/ha、
より好ましくは、50~100g/ha
の施用量の、アザフェニジン、ホメサフェン及びラクトフェンから選択されるPPO阻害性除草剤により防除されなかった(すなわち、処理の2週間後に決定すると、目視による評点において、雑草防除が 70%の雑草抑制又は根絶となる)雑草である一方、個々の感受性バイオタイプは、その使用量では防除されない(すなわち、目視による評点において、処理の2週間後に決定すると、雑草防除が 90%の雑草抑制又は根絶となる)。

30

【0728】

同様に好ましくは、PPO耐性雑草は、
200g/ha以下、
特に好ましくは、100g/ha以下、
とりわけ好ましくは、50~200g/ha、
より好ましくは、50~100g/ha
の施用量の、ホメサフェン及びラクトフェンから選択されるPPO阻害性除草剤により防除されなかった(すなわち、処理の2週間後に決定すると、目視による評点において、雑草防除が 70%の雑草抑制又は根絶となる)雑草である一方、個々の感受性バイオタイプは、その使用量では防除されない(すなわち、目視による評点において、処理の2週間後に決定すると、雑草防除が 90%の雑草抑制又は根絶となる)。

40

【0729】

同様に好ましくは、PPO耐性雑草は、
200g/ha以下、
特に好ましくは、100g/ha以下、

50

とりわけ好ましくは、50～200g/ha、
より好ましくは、50～100g/ha

の施用量の、アシフルオルフェン、アザフェニジン、カルフェントラゾン、フルミクロラック、フルミオキサジン、ホメサフェン、ラクトフェン、オキサジアゾン、オキシフルオルフェン、ピラフルフェン及びスルフェントラゾンから選択されるPPO阻害性除草剤により、防除されなかつた(すなわち、処理の2週間後に決定すると、目視による評点において、雑草防除が 70%の雑草抑制又は根絶となる)雑草である一方、個々の感受性バイオタイプは、その使用量では防除されない(すなわち、目視による評点において、処理の2週間後に決定すると、雑草防除が 90%の雑草抑制又は根絶となる)。

【0730】

10

同様に、好ましくは、PPO耐性雑草は、
200g/ha以下、
特に好ましくは、100g/ha以下、
とりわけ好ましくは、50～200g/ha、
より好ましくは、50～100g/ha

の施用量の、アシフルオルフェン、カルフェントラゾン、フルミクロラック、フルミオキサジン、ホメサフェン、ラクトフェン、オキサジアゾン、オキシフルオルフェン、ピラフルフェン及びスルフェントラゾンから選択されるPPO阻害性除草剤により防除されなかつた(すなわち、処理の2週間後に決定すると、目視による評点において、雑草防除が 70%の雑草抑制又は根絶となる)雑草である一方、個々の感受性バイオタイプは、その使用量では防除されない(すなわち、目視による評点において、処理の2週間後に決定すると、雑草防除が 90%の雑草抑制又は根絶となる)。

20

【0731】

同様に好ましくは、PPO耐性雑草は、「PPO耐性」として分類されるものであり、従つて、作者不明のherbicide mode of action - weeds resistant to PPO-inhibitors(URL:<http://www.weedscience.org/summary/MOA.aspx>)のリストに従ってリストされている。

【0732】

30

特に好ましいPPO耐性雑草は、アカリファ属の種(*Acalypha* ssp.)、ヒュ属の種(*Amaranthus* ssp.)、アンブロシア属の種(*Ambrosia* ssp.)、カラスムギ属の種(*Avena* ssp.)、イズハハコ属の種(*Conyza* ssp.)、クジラグサ属の種(*Descurainia* ssp.)、トウダイグサ属の種(*Euphorbia* ssp.)及びセネシオ属の種(*Senecio* ssp.);
とりわけ好ましくは、ヒュ属の種、アンブロシア属の種及びトウダイグサ属の種;
より好ましくは、ヒュ属の種及びアンブロシア属の種からなる群から選択される。

【0733】

同様に特に好ましいPPO耐性雑草は、以下からなる群:
エノキグサ(*Acalypha australis*)、ホソアオゲイトウ(*Amaranthus hybridus*)、オオホナガアオゲイトウ(*Amaranthus palmeri*)、アオゲイトウ(*Amaranthus retroflexus*)、ヒュモドキ/タリホノアオゲイトウ(ヒュモドキ(*Amaranthus tuberculatus*)、タリホノアオゲイトウ(*Amaranthus rudis*)又はナガホアオビュ(*Amaranthus tamariscinus*))、一般的なブタクサ(ブタクサ(*Ambrosia artemisiifolia*))、カラスムギ(*Avena fatua*)、ノミヨケソウ(アレチノギク(*Conyza ambigua*))、ヒメムカシヨモギ(*Conyza Canadensis*)、クジラグサ(*Descurainia sophia*)、ショウジョウトラノオ(ショウジョウソウモドキ(*Euphorbia heterophylla*))及びハナノボロギク(*Senecio vernalis*);
とりわけ好ましいのは、ホソアオゲイトウ、オオホナガアオゲイトウ、アオゲイトウ、ヒュモドキ/タリホノアオゲイトウ(ヒュモドキ、タリホノアオゲイトウ又はナガホアオビュ);
より好ましいのは、ヒュモドキ/タリホノアオゲイトウ(ヒュモドキ、タリホノアオゲイトウ又はナガホアオビュ)及び一般的なブタクサから選択される。

40

【0734】

50

大部分のPPO耐性雑草、特に、ヒュモドキのバイオタイプは、ミトコンドリア及び葉緑体を二重標的とするPPO酵素をコードする、核コード遺伝子PPX2Lにおけるコドン欠失のために耐性がある。これにより、210位のグリシンアミノ酸が欠失する(例えば、B. G. Youngら、Characterization of PPO-Inhibitor-Resistant Waterhemp (*Amaranthus tuberculatus*) Response to Soil-Applied PPO-Inhibiting Herbicides、Weed Science 2015年、63巻、511～521頁を参照されたい)。

【0735】

特に、ブタクサの耐性バイオタイプにおける変異の第2のタイプは、PPX2酵素のR98L変化を発現した変異として特定された(S. L. Rousonelos、R. M. Lee、M. S. Moreira、M. J. VanGessel、P. J. Tranell、Characterization of a Common Ragweed (*Ambrosia artemisiifolia*) Population Resistant to ALS- and PPO-Inhibiting Herbicides、Weed Science 60巻、2012年、335～344頁)。

10

【0736】

従って、好ましくは、PPO耐性雑草は、そのプロトックス酵素が、それぞれ、前記プロトックス酵素又はPPX2L若しくはPPX2に対する等価物のG210又はR98L変化として発現される変異、特に前記プロトックス酵素のG210又はR98L変化として発現される変異のために、PPO阻害剤の施用に耐性となる雑草である。

【実施例】

【0737】

式(I)のフェニルウラシルの調製は、実施例によって例示される;しかし、本発明の主題は、示される実施例に限定されるものではない。

20

【0738】

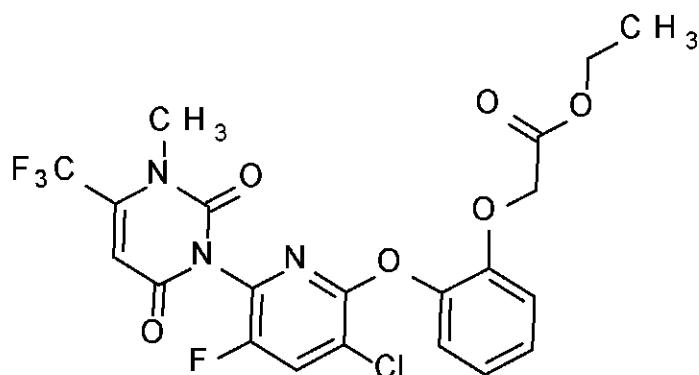
A:調製実施例

[実施例1]

エチル2-[2-[[3-クロロ-5-フルオロ-6-[3-メチル-2,6-ジオキソ-4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-1-イル]-2-ピリジル]オキシ]フェノキシ]アセテート

【0739】

【化68】

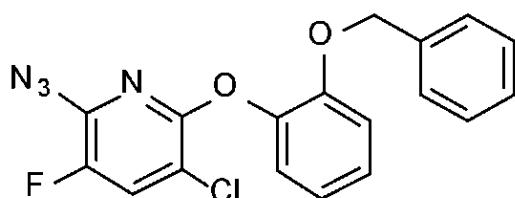


30

実施例1.1:2-アジド-6-(2-ベンジルオキシフェノキシ)-5-クロロ-3-フルオロ-ピリジン

【0740】

【化69】



40

50

【0741】

5.0g(29mmol)の3-クロロ-2,5,6-トリフルオロピリジン(CAS2879-42-7)のDMSO(50mL)溶液に、2.1g(33mmol)のNaN₃を加え、この溶液を室温で3時間、攪拌した。次に、19.5g(60mmol)のCs₂CO₃、次いで、6.2g(31mmol)の2-(ベンジルオキシ)フェノールのDMSO(40mL)溶液を加えた。この混合物を室温で16時間、攪拌し、水を加え、この混合物を酢酸エチルにより抽出した。有機層を分離し、ブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。粗製物質(15g)を、さらなる精製を行わずに次のステップで使用した。

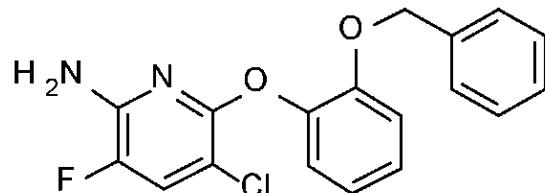
[M+H] = 371.0; Rt = 1.368分

【0742】

実施例1.2:2-アミノ-6-(2-ベンジルオキシフェノキシ)-5-クロロ-3-フルオロ-ピリジン

【0743】

【化70】



10

【0744】

15gの化合物1.1のTHF溶液に、9.7g(150mmol)の亜鉛、及び100mLの半飽和水性NH₄Clを0℃で滴下して加えた。この混合物を室温で16時間、攪拌し、濾過し、濾過ケーキを酢酸エチルで洗浄した。濾液を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機層を無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。シリカゲルカラム(石油エーテル/酢酸エチル)により粗製物質を精製して、8.8g(25.6mmol、3-クロロ-2,5,6-トリフルオロピリジンから2ステップで88%)の所望の生成物1.2を得た。

[M+H] = 345.0; Rt = 1.232分

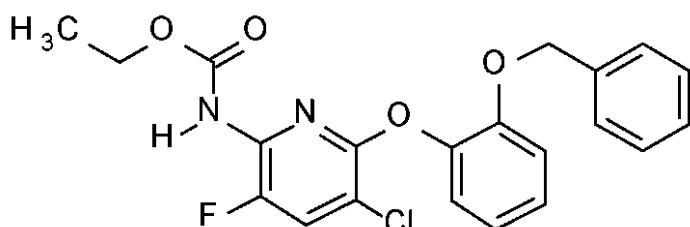
【0745】

実施例1.3:エチルN-[6-(2-ベンジルオキシフェノキシ)-5-クロロ-3-フルオロ-2-ピリジル]カルバメート

30

【0746】

【化71】



40

【0747】

8.8g(25.6mmol)の化合物1.2のジクロロメタン(80mL)溶液に、3g(38mmol)のピリジン、次いで4g(37.5mmol)のクロロギ酸エチルを加えた。この混合物を25℃で20時間、攪拌し、水で希釈し、ジクロロメタンで抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄により脱水し、濃縮して、カルバメート1.3及び二置換誘導体の混合物14.4gを得た。この粗製混合物(12.4g)をエタノール200mLに溶解し、攪拌しながら、0℃でNaOH(1M)水溶液を滴下して加えた。この混合物を15℃で6時間、攪拌し、ブラインで希釈し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。シリカ上のカラムクロマトグラフィー(石油エーテル/酢酸エチル)に

50

より粗生成物を精製して、6.6g(15.9mmol、62%)の所望の化合物1.3を得た。

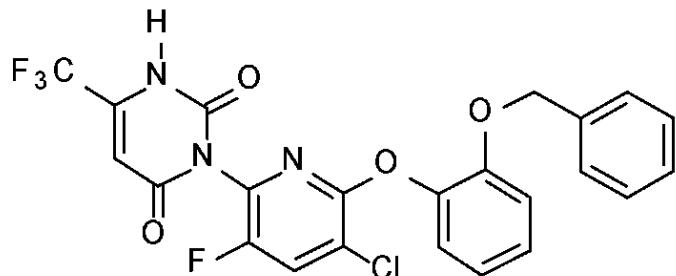
[M+H] = 417.1; Rt = 1.293分

【0748】

実施例1.4:3-[6-(2-ベンジルオキシフェノキシ)-5-クロロ-3-フルオロ-2-ピリジル]-6-(トリフルオロメチル)-1H-ピリミジン-2,4-ジオン

【0749】

【化72】



10

【0750】

NaH 1.7g(43mmol)のNMP(N-メチル-2-ピロリドン)(60mL)溶液に、0℃で6g(14mmol)の化合物1.3を加え、この混合物を35℃で30分間、攪拌した。次に、3.9g(21mmol)のエチル(E)-3-アミノ-4,4,4-トリフルオロ-ブタ-2-エノエート(CAS:372-29-2)を加え、この反応混合物を100℃で3日間、攪拌した。得られた混合物を氷水によりクエンチし、6N HClを使用することによりpH=2へと酸性にし、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄により脱水し、濃縮し、次のステップで直接、使用した。

[M+H] = 508.0; Rt = 1.240分

【0751】

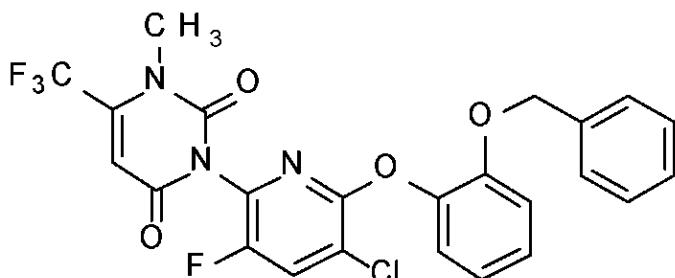
実施例1.5:3-[6-(2-ベンジルオキシフェノキシ)-5-クロロ-3-フルオロ-2-ピリジル]-1-メチル-6-(トリフルオロメチル)-ピリミジン-2,4-ジオン

【0752】

【化73】

20

30



【0753】

6.5g(12.8mmol)の化合物1.4のアセトニトリル(65mL)の溶液に、攪拌しながら、0℃で、5.3g(38mmol)のK₂CO₃、次いで7.3g(51mmol)のヨウ化メチルを加えた。この混合物を15℃で16時間、攪拌し、次に水(80mL)を加え、2N HClを使用することにより、pHをpH=5に調節した。この混合物を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機層をブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去して、7gの粗生成物1.5を得、これをさらなる精製を行わずに使用した。

¹H-NMR (CDCl₃, ppm): 7.63 (d, J=7.28 Hz, 1 H); 7.21 - 7.25 (m, 4 H); 7.12 - 7.17 (m, 2 H); 6.98 (t, J=7.03 Hz, 3 H); 6.26 (s, 1 H); 4.99 (s, 2 H); 3.47 (s, 3 H).

[M+H] = 522.0; Rt = 1.323分

【0754】

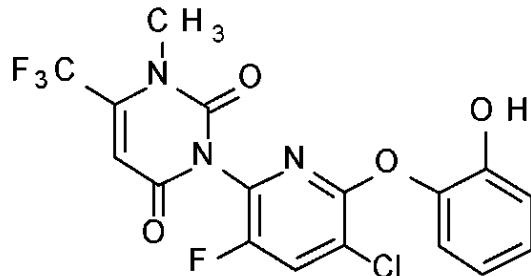
40

50

実施例1.6:3-[5-クロロ-3-フルオロ-6-(2-ヒドロキシフェノキシ)-2-ピリジル]-1-メチル-6-(トリフルオロメチル)ピリミジン-2,4-ジオン

【0755】

【化74】



10

【0756】

7g(13.4mmol)の化合物1.5のキシレン(70mL)溶液に、15℃で搅拌しながら、3.6g(2.6mmol)の固体AlCl₃を加えた。この混合物を130℃で16時間、搅拌し、15℃に冷却した後、この混合物に氷水を加えた。キシレン層を分離した後、水相を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機層を無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。シリカゲル上のカラムクロマトグラフィー(石油エーテル/酢酸エチル)により粗生成物を精製して、3.2g(7.4mmol、55%)の所望の生成物1.6を得た。

20

¹H-NMR (CDCl₃, ppm): 7.80 (d, J=7.26 Hz, 1H); 7.03 - 7.19 (m, 3H); 6.93 (dt, J=7.68 Hz, J=1.7 Hz, 1H); 6.3 (s, 1H); 5.6 (s, 1H); 3.5 (s, 3H).

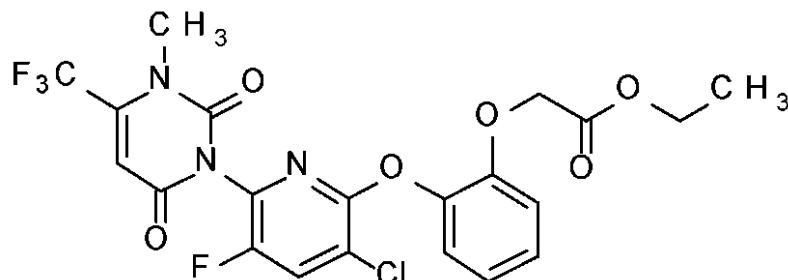
[M+H] = 431.9; Rt = 1.077分

【0757】

実施例1.7:エチル2-[2-[[3-クロロ-5-フルオロ-6-[3-メチル-2,6-ジオキソ-4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-1-イル]-2-ピリジル]オキシ]フェノキシ]アセテート(=実施例1)

【0758】

【化75】



30

【0759】

0.2g(0.46mmol)の化合物1.6の乾燥アセトニトリル(10mL)の溶液に、0℃で、0.19g(1.3mmol)のK₂CO₃を加え、次いで0.15g(0.92mmol)のブロモ酢酸エチルを滴下して加えた。この混合物を15℃で16時間、搅拌し、水15mLで希釈し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。逆相分取HPLC(アセトニトリル/水(トリフルオロ酢酸を含有))により粗生成物を精製して、0.16g(0.31mmol、67%)の所望の表題化合物を得た。

40

¹H-NMR (CDCl₃, ppm): 7.76 (d, J=7.28 Hz, 1H); 7.22 (d, J=7.72 Hz, 1H); 7.17 (t, J=7.83 Hz, 1H); 6.99 - 7.06 (m, 1H); 6.88 (d, J=7.94 Hz, 1H); 6.25 (s, 1H); 4.49 (s, 2H); 4.19 (q, J=7.20 Hz, 2H); 3.47 (s, 3H); 1.25 (t, J=7.17 Hz, 3H).

[M+H] = 518.0; Rt = 1.217分

【0760】

エタノールからの再結晶により、結晶形態Aの表題化合物が得られる。

50

【0761】

実施例1の結晶形態Aは、96~108 の範囲に特徴的な融解ピークを有する、サーモグラムを示す。融解ピークの発生として決定される融点は、通常、約100~106 の範囲にある。引用した値は、ここでは、示差熱測定(示差走査熱量測定、DSC)によって決定した値に関する。融点は、Mettler Toledo DSC823e/700/229モジュールを備えたDSCを使用して決定した。試料は、ガラス製標準パンに入れた。試料サイズは、各場合において、1~20mgとした。加熱速度は、2.50K/分とした。実験中、試料に窒素流をバージした。融点は、ピークの主要側に基づいて、融解ピークの半分の高さにおける接線と直線的に外挿した初期ベースラインとの交点によって定義される、外挿ピーク開始温度(いわゆる、開始温度)として決定した。

10

【0762】

形態Aは、粉末X線回折(PXRD)によって検討した。PXRDは、反射配置(Bragg-Brentano)におけるCuK α を使用した、Panalytical X'Pert Pro X線回折計を用いて実施した。0.2mm深さの単結晶ケイ素の試料ホルダーに粉末を入れ、優しく正確に平坦にした。管電圧は45kVであり、電流は40mAである。PXRDデータは、室温で、例えば、0.017°刻みの2 θ = 3.0° ~ 40.0° の範囲で、19.7s/ステップの測定時間で採集する。

【0763】

PXRDパターンが、図1に表示されている。特徴的なピークの位置が表2にリストされている:

【0764】

20

【表8】

表2:その形態Aにおける、実施例1のPXRDパターンで観察されたピーク位置:

$^{\circ}\theta$, Cu K α 放射	d [Å]
5.5 ± 0.2	16.2 ± 0.6
7.4 ± 0.2	12.0 ± 0.3
7.8 ± 0.2	11.4 ± 0.3
10.0 ± 0.2	8.9 ± 0.2
10.3 ± 0.2	8.6 ± 0.2
11.2 ± 0.2	7.9 ± 0.1
11.8 ± 0.2	7.5 ± 0.1
17.1 ± 0.2	5.19 ± 0.06
18.0 ± 0.2	4.92 ± 0.06
18.8 ± 0.2	4.73 ± 0.05
19.3 ± 0.2	4.59 ± 0.05
20.9 ± 0.2	4.24 ± 0.04
21.5 ± 0.2	4.13 ± 0.04
21.9 ± 0.2	4.06 ± 0.04
23.0 ± 0.2	3.87 ± 0.04
26.3 ± 0.2	3.39 ± 0.03

30

40

【0765】

最も顕著なピークは、5.5 ± 0.2、7.4 ± 0.2、7.8 ± 0.2、10.0 ± 0.2、11.2 ± 0.2、17.1 ± 0.2、18.0 ± 0.2、21.5 ± 0.2、21.9 ± 0.2及び26.3 ± 0.2 である。

【0766】

形態Aの単結晶に関する検討により、基本結晶構造が三斜晶系であることが実証される。単位格子は、空間群P1-を有する。結晶構造(100Kで決定)の特徴的データが、以下の表3にまとめられている。

【0767】

50

【表9】

表3

パラメータ	実施例1の形態A
分類	三斜晶系
空間群	$P\bar{1}$
a	11.1534(8) Å
b	12.4573(9) Å
c	16.8546(12) Å
α	72.960(3)°
β	82.651(3)°
γ	83.283(3)°
体積	2212.8(3) Å ³
Z	4
密度(計算値)	1.554 g/cm ³
波長	1.54178 Å
最長回折ピーク及びホール	0.716 / -0.362 eÅ ⁻³

 a, b, c = 単位格子長さ α, β, γ = 単位格子角 Z = 単位格子中の分子数

10

20

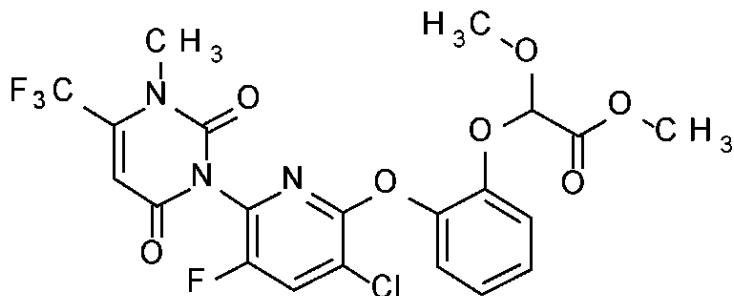
【0768】

[実施例2]

メチル2-[2-[[3-クロロ-5-フルオロ-6-[3-メチル-2,6-ジオキソ-4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-1-イル]-2-ピリジル]オキシ]フェノキシ]-2-メトキシ-アセテート

【0769】

【化76】



30

【0770】

2.5g(5.8mmol)の化合物1.6の乾燥アセトニトリル(20mL)の溶液に、N₂下、攪拌しながら、0 °Cで、2.2g(16mmol)のK₂CO₃を10分間かけて加えた。次に、1.4g(7.5mmol)の2-ブロモ-2-メトキシ-酢酸メチル(CAS:5193-96-4)をこの混合物に滴下して加え、この混合物を15 °Cで16時間、攪拌した。この混合物を濾過し、濾過ケーキを酢酸エチルで洗浄した。濾液を濃縮し、逆相分取HPLC(アセトニトリル/水(トリフルオロ酢酸を含有))により粗生成物を精製して、0.97g(1.8mmol、31%)の所望の化合物2を得た。

40

¹H-NMR (CDCl₃, ppm): 7.77 (d, J=7.03 Hz, 1 H); 7.15 - 7.27 (m, 3 H); 7.07 - 7.13 (m, 1 H); 6.24 (s, 1 H); 5.40 (d, J=8.53 Hz, 1 H); 3.70 (s, 3 H); 3.46 (br. s., 3 H); 3.39 (s, 3 H).

40

[M+H]⁺ = 534.1; Rt = 1.233分

【0771】

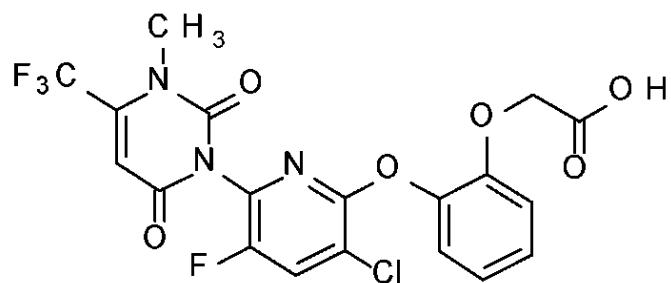
[実施例3]

2-[2-[[3-クロロ-5-フルオロ-6-[3-メチル-2,6-ジオキソ-4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-1-イル]-2-ピリジル]オキシ]フェノキシ]酢酸

50

【0772】

【化77】



10

【0773】

水性濃HCl(20mL)及び20mLの冰酢酸中の3.5g(6.8mmol)のエチル2-[2-[[3-クロロ-5-フルオロ-6-[3-メチル-2,6-ジオキソ-4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-1-イル]-2-ピリジル]オキシ]フェノキシ]アセテート(実施例1)の溶液を60℃で3時間、攪拌した。水を加え、この混合物を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を水及びブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去して、2.3g(4.7mmol、69%)の2-[2-[[3-クロロ-5-フルオロ-6-[3-メチル-2,6-ジオキソ-4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-1-イル]-2-ピリジル]オキシ]フェノキシ]酢酸を得た。

¹H-NMR (CDCl₃, ppm): 7.77 (d, J=7.21 Hz, 1H); 7.15 - 7.25 (m, 2H); 7.06 (dt, J=7.74 Hz, J= 1.46 Hz, 1H); 6.91 (dd, J=8.15 Hz, J= 1.44 Hz, 1H); 6.25 (s, 1H); 4.55 (s, 2H), 3.45 (s, 3H).

20

[M+H] = 490.0; Rt = 1.189分

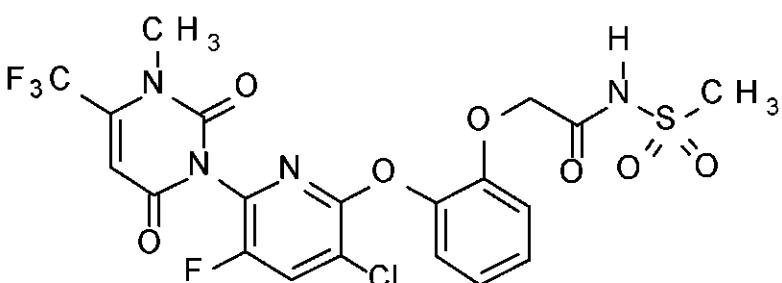
【0774】

[実施例4]

2-[2-[[3-クロロ-5-フルオロ-6-[3-メチル-2,6-ジオキソ-4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-1-イル]-2-ピリジル]オキシ]フェノキシ]-N-メチルスルホニル-アセトアミド

【0775】

【化78】



30

【0776】

0.7g(1.5mmol)の2-[2-[[3-クロロ-5-フルオロ-6-[3-メチル-2,6-ジオキソ-4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-1-イル]-2-ピリジル]オキシ]フェノキシ]酢酸の乾燥THF(20mL)溶液に、アルゴン雰囲気下、1.0g(7.4mmol)のジイソプロピルエチルアミン、次いで0.8g(3.0mmol)の塩化2-クロロ-1-メチル-ピリジニウム(CAS:112277-86-8)及び0.2g(2.2mmol)のメタンスルホニアミド(CAS:3144-09-0)を加えた。この懸濁液を室温で16時間、攪拌した。次に、水を加え、この混合物を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機層を水及びブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。シリカ上のカラムクロマトグラフィー(シクロヘキサン/酢酸エチル)により粗生成物を精製して、0.1g(0.24mmol、16%)の所望の生成物を得た。

40

¹H-NMR (CDCl₃, ppm): 8.6 (s, 1H); 7.8 (d, 1H); 7.2 - 7.3 (m, 2H); 7.1 (m, 1H); 6.9 (d, 1H); 6.3 (s, 1H); 4.5 (s, 2H); 3.5 (s, 3H); 3.1 (s, 3H).

50

[M+H] = 567.1; Rt = 1.123分

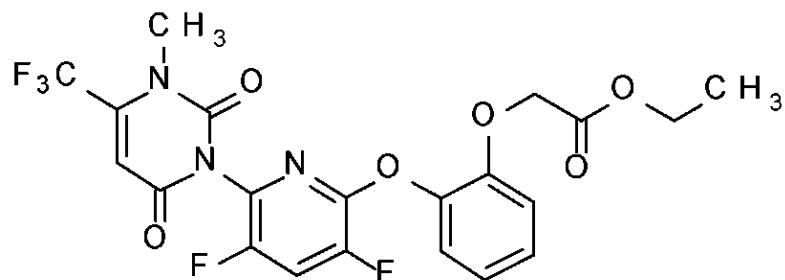
【0777】

[実施例5]

エチル2-[2-[[3,5-ジフルオロ-6-[3-メチル-2,6-ジオキソ-4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-1-イル]-2-ピリジル]オキシ]フェノキシ]アセテート

【0778】

【化79】



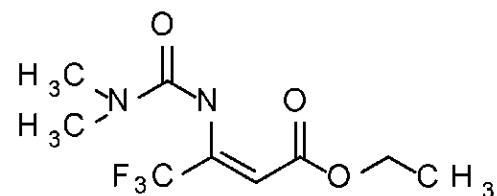
10

【0779】

実施例5.1: エチル(Z)-3-(ジメチルカルバモイルアミノ)-4,4,4-トリフルオロ-ブタ-2-エノエート

【0780】

【化80】



20

【0781】

N₂雰囲気下、104g(2.73mol)のNaHの乾燥DMF(600mL)溶液に、攪拌しながら、乾燥DMF(200mL)に溶解した233g(2.18mol)の塩化N,N-ジメチルカルバモイル(CAS:79-44-7)を0~5℃で1時間かけて、滴下して加えた。次に、乾燥DMF(200mL)に溶解した200g(1.09mol)のエチル(Z)-3-アミノ-4,4,4-トリフルオロ-ブタ-2-エノエート(CAS:372-29-2)を、攪拌しながら、0~5℃の温度で1時間かけて、滴下して加えた。この混合物を室温で、さらに2時間、攪拌し、次に、氷水に注ぎ入れた。この混合物を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機層をブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。シリカ上のカラムクロマトグラフィー(石油エーテル/酢酸エチル)により粗生成物を精製して、170g(0.67mol、64%)の所望の生成物5.1を得た。

30

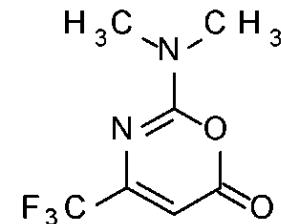
【0782】

実施例5.2: 2-(ジメチルアミノ)-4-(トリフルオロメチル)-1,3-オキサジン-6-オン

40

【0783】

【化81】



【0784】

50

102mLのPOCl₃中の170g(0.67mol)の化合物5.1の溶液に、0℃で15分間の搅拌間隔で3回にわけて、139g(0.67mol)のPCl₅を加え、この混合物を0℃でさらに1時間、搅拌した。次に、この混合物を室温でさらに3時間、搅拌した。この反応混合物を250mLの冰水に注ぎ入れ、沈殿物を濾過により採集し、乾燥して、84g(0.40mol、60%)の所望の生成物5.2を得た。

¹H-NMR (CDCl₃, ppm): 5.9 (s, 1H); 3.2 (d, J=19.58 Hz, 6H).

[M+H] = 209.1; Rt = 0.980分

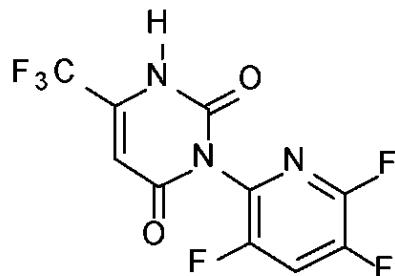
【0785】

実施例5.3:6-(トリフルオロメチル)-3-(3,5,6-トリフルオロ-2-ピリジル)-1H-ピリミジン-2,4-ジオン

10

【0786】

【化82】



20

【0787】

冰酢酸(15mL)中の1.5g(15.2mmol)の2-アミノ-3,5,6-トリフルオロピリジン(CAS35-34-50-7)及び3.1g(15.2mmol)の化合物5.2の溶液を95℃で16時間、搅拌した。次に、水を加え、この混合物を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を水及びブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去して、3.9g(12.5mmol、82%)の所望の生成物5.3を得た。

¹H-NMR (CDCl₃, ppm): 7.6 (m, 1H); 6.25 (s, 1H).

[M+H] = 312.0; Rt = 0.873分

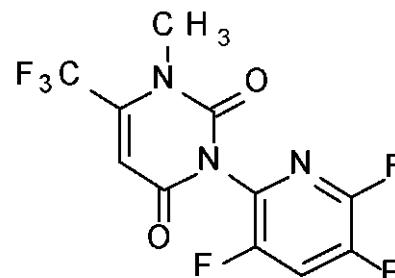
【0788】

30

実施例5.4:1-メチル-6-(トリフルオロメチル)-3-(3,5,6-トリフルオロ-2-ピリジル)ピリミジン-2,4-ジオン

【0789】

【化83】



40

【0790】

35g(0.11mol)の化合物5.3のDMF(400mL)の溶液に、0℃で、31g(0.23mol)のK₂CO₃、次いで32g(0.23mol)のヨウ化メチルを加え、この混合物を室温で16時間、搅拌した。次に、水を加え、この混合物を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機層を水及びブラインで洗浄し、次に、無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。シリカ上のカラムクロマトグラフィー(石油エーテル/酢酸エチル)により粗生成物を精製して、15g(46mmol、42%)の所望の生成物5.4を得た。

50

¹H-NMR (CDCl₃, ppm): 7.6 (q, J=7.06 Hz, 1H); 6.4 (s, 1H); 3.6 (s, 3H).

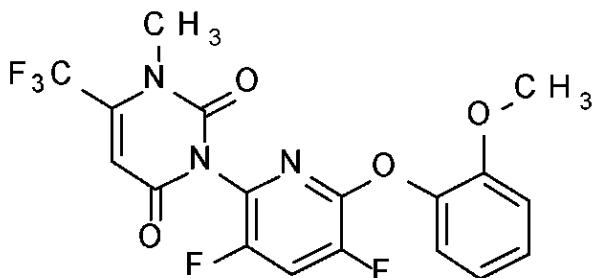
[M+H] = 325.9; Rt = 1.058分

【0791】

実施例5.5:3-[3,5-ジフルオロ-6-(2-メトキシフェノキシ)-2-ピリジル]-1-メチル-6-(トリフルオロメチル)ピリミジン-2,4-ジオン

【0792】

【化84】



10

【0793】

THF(400mL)中の5g(0.04mmol)の2-メトキシフェノール(CAS:90-05-1)の溶液に、攪拌しながら、0℃で6.9g(0.06mol)のKO^tBuを5分間かけて加えた。次に、10g(31mmol)の化合物5.4を加え、この混合物を2時間、80℃に加熱し、次に、氷水に注ぎ入れた。この混合物を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機層をブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。シリカ上のカラムクロマトグラフィー(石油エーテル/酢酸エチル)により粗生成物を精製して、9.3g(22mmol、71%)の所望の生成物5.5を得た。

20

¹H-NMR (CDCl₃, ppm): 7.5 (t, J=7.78 Hz, 1H); 7.2 - 7.3 (m, 2H); 6.9 - 7.0 (m, 2H); 6.3 (s, 1H); 3.7 (s, 3H).

[M+H] = 430.0; Rt = 1.197分

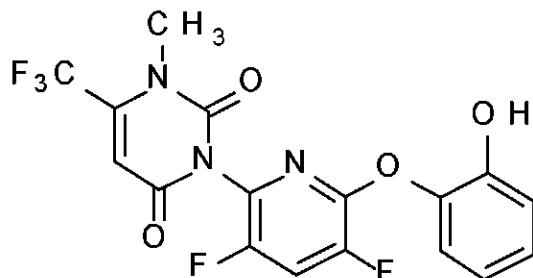
【0794】

実施例5.6:3-[3,5-ジフルオロ-6-(2-ヒドロキシフェノキシ)-2-ピリジル]-1-メチル-6-(トリフルオロメチル)ピリミジン-2,4-ジオン

30

【0795】

【化85】



40

【0796】

-78℃に冷却した9g(20mmol)の化合物5.5のジクロロメタン(200mL)溶液に、ジクロロメタン(50mL)中の7.9g(30mmol)のBBr₃を加えた。この混合物を5時間かけて、室温に温め、氷水に注ぎ入れて、ジクロロメタンで抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去して、所望の生成物5.6を得、これをさらなる精製を行わずに次のステップで使用した。

¹H-NMR (CDCl₃, ppm): 7.54 (m, 1H); 7.09 - 7.18 (m, 2H); 7.00 - 7.08 (m, 1H); 6.87 - 6.96 (m, 1H); 6.3 (s, 1H); 5.7 (br. s., 1H); 3.5 (s, 3H).

[M+H] = 416.0; Rt = 1.117分

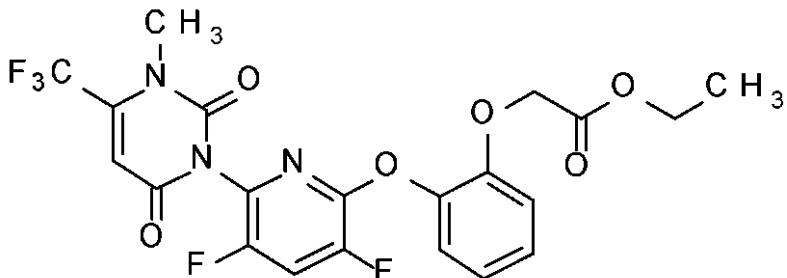
50

【0797】

実施例5.7:エチル2-[2-[[3,5-ジフルオロ-6-[3-メチル-2,6-ジオキソ-4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-1-イル]-2-ピリジル]オキシ]フェノキシ]アセテート

【0798】

【化86】



10

【0799】

9.5g(22.8mmol)の化合物5.6のアセトニトリル(300mL)溶液に、攪拌しながら、0で、6.3g(45.7mmol)のK₂CO₃を加えた。次に、7.6g(45.7mmol)のプロモ酢酸エチル(CAS:105-36-2)を加え、この混合物を80で16時間、攪拌した。水を加え、この混合物を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機層を無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。シリカ上のカラムクロマトグラフィー(石油エーテル/酢酸エチル)により粗生成物を精製し、メチルtert-ブチルエーテル及びn-ヘキサンから再結晶して、3.9g(7.8mmol、34%)の所望の生成物5.7を得た。

20

¹H-NMR (CDCl₃, ppm): 7.5 (t, J=7.83 Hz, 1H); 7.2 (d, J=7.50 Hz, 1H); 7.1 - 7.2 (m, 1H); 7.0 (t, J=7.72 Hz, 1H); 6.9 (d, J=8.16 Hz, 1H); 6.3 (s, 1H); 4.5 (s, 1H); 4.2 (q, J=7.13 Hz, 2H); 3.5 (s, 3H); 1.3 (t, J=7.17 Hz, 3H).

[M+H] = 502.2; Rt = 1.221分

【0800】

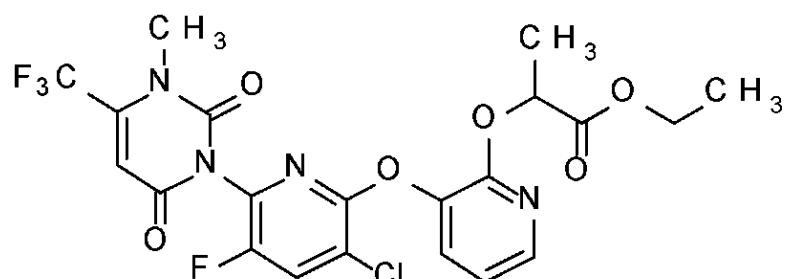
[実施例6]

エチル2-[[3-[[3-クロロ-5-フルオロ-6-[3-メチル-2,6-ジオキソ-4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-1-イル]-2-ピリジル]オキシ]-2-ピリジル]オキシ]プロパノエート

30

【0801】

【化87】



40

【0802】

DMSO(4mL)中の0.22g(1.1mmol)のエチル2-[(3-ヒドロキシ-2-ピリジル)オキシ]プロパノエート(CAS:353292-83-8)の溶液に、15で0.042g(1.1mmol)のNaHを加えた。この懸濁液をこの温度で10分間、攪拌した後、この混合物に15で0.3g(0.88mmol)の3-(5-クロロ-3,6-ジフルオロ-2-ピリジル)-1-メチル-6-(トリフルオロメチル)ピリミジン-2,4-ジオンを加えた。得られた混合物を90~100で2時間、攪拌し、水に注ぎ入れ、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。逆相分取HPLC(アセトニトリル/水(トリフルオロ酢酸を含有))により粗生成物を精製して、0.17g(0.32mmol、36%)の所望の生成物を得た。

50

¹H-NMR (CDCl₃, ppm): 7.9 (d, J=4.52 Hz, 1H); 7.8 (d, J=7.28 Hz, 1H); 7.5 (d, J=7.53 Hz, 1H); 6.9 (t, J=5.52 Hz, 1H); 6.3 (d, J=3.26 Hz, 1H); 5.0-5.1 (m, 1H); 4.2 (q, J=7.11 Hz, 2H); 3.5 (d, J=4.27 Hz, 3H); 1.4 (d, J=7.03 Hz, 3H); 1.2 (t, J=7.15 Hz, 3H).

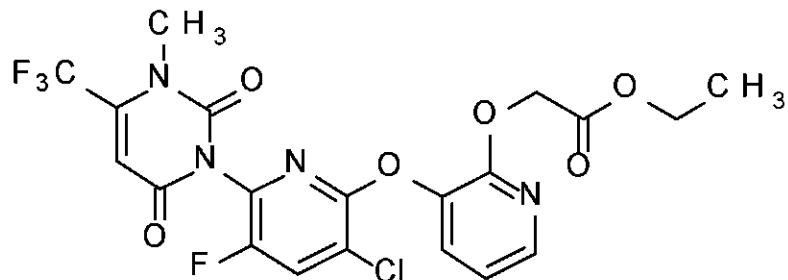
【0803】

[実施例7]

エチル2-[[3-[[3-クロロ-5-フルオロ-6-[3-メチル-2,6-ジオキソ-4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-1-イル]-2-ピリジル]オキシ]-2-ピリジル]オキシ]アセテート

【0804】

【化88】



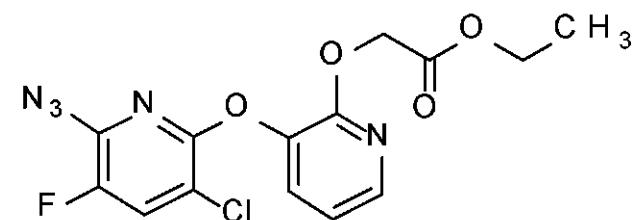
10

【0805】

実施例7.1: エチル2-[[3-[(6-アジド-3-クロロ-5-フルオロ-2-ピリジル)オキシ]-2-ピリジル]オキシ]アセテート

【0806】

【化89】



30

【0807】

1.8g(10.78mmol)の3-クロロ-2,5,6-トリフルオロピリジン(CAS2879-42-7)のDMSO(20mL)溶液に、室温で0.77g(11.8mmol)のアジ化ナトリウムを加え、この混合物を室温で3時間、攪拌した。次に、DMSO(10mL)中の2.2g(11.3mmol)のエチル2-[(3-ヒドロキシ-2-ピリジル)オキシ]アセテート(CAS:353292-81-6)及び7g(21.5mmol)のCs₂CO₃の懸濁を、上記の混合物に小分けにして加えた。得られた混合物を室温で15時間、攪拌し、水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。粗生成物7.1は、さらなる精製を行わずに次のステップで使用した。

40

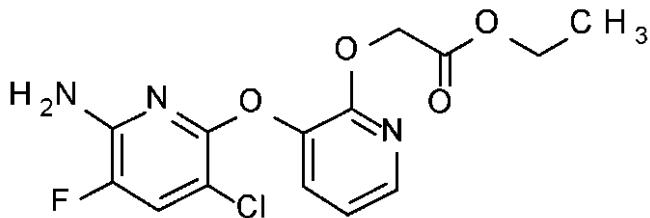
【0808】

実施例7.2: エチル2-[[3-[(6-アミノ-3-クロロ-5-フルオロ-2-ピリジル)オキシ]-2-ピリジル]オキシ]アセテート

【0809】

50

【化90】



【0810】

10 THF(100mL)中の4.8g(13mmol)の化合物7.1及び4.3g(66mmol)の亜鉛からなる懸濁液に、0℃で、半飽和NH₄Cl水溶液(50mL)を滴下して加えた。この混合物を室温で5時間、攪拌し、濾過し、濾過ケーキを酢酸エチルで洗浄した。濾液に水(200mL)を加え、この混合物を酢酸エチルで抽出し、有機層を無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。シリカ上のカラムクロマトグラフィー(石油エーテル/酢酸エチル)により粗生成物を精製して、2.7g(8mmol、61%)の所望の生成物7.2を得た。

¹H-NMR (CDCl₃, ppm): 7.9 (dd, J=4.89 Hz, J=1.51 Hz, 1H); 7.4 (d, J=7.39 Hz, 1H); 7.3 (d, J=9.06 Hz, 1H); 6.9 (dd, J=7.65 Hz, J=4.89 Hz, 1H); 4.9 (s, 2H); 4.5 (s, 2H); 4.2 (q, J=7.15 Hz, 2H); 1.25 (t, J=7.15 Hz, 3H).

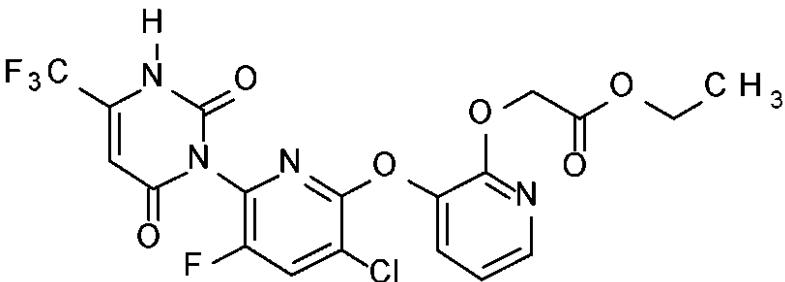
[M+H] = 428.1; Rt = 1.332分

【0811】

実施例7.3:エチル2-[[3-[[3-クロロ-6-[2,4-ジオキソ-6-(トリフルオロメチル)-1H-ピリミジン-3-イル]-5-フルオロ-2-ピリジル]オキシ]-2-ピリジル]オキシ]アセテート

【0812】

【化91】



【0813】

氷酢酸(430mL)中の16g(47mmol)の化合物7.2及び9.8g(47mmol)の化合物5.2の溶液を80℃で16時間、攪拌した。次に、9.8g(47mmol)の化合物5.2を加え、この混合物を80℃で16時間、攪拌した。再度、2.9g(14mmol)の化合物5.2を加え、この混合物を80℃で16時間、攪拌した。再度、9.8g(47mmol)の化合物5.2を加え、この混合物を80℃で16時間、攪拌した。次に、水を加え、この混合物を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機層を水及びブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。粗生成物7.3(23g、46mmol、97%)をさらなる精製を行わずに次のステップで使用した。

【0814】

実施例7.4:エチル2-[[3-[[3-クロロ-5-フルオロ-6-[3-メチル-2,6-ジオキソ-4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-1-イル]-2-ピリジル]オキシ]-2-ピリジル]オキシ]アセテート

【0815】

10

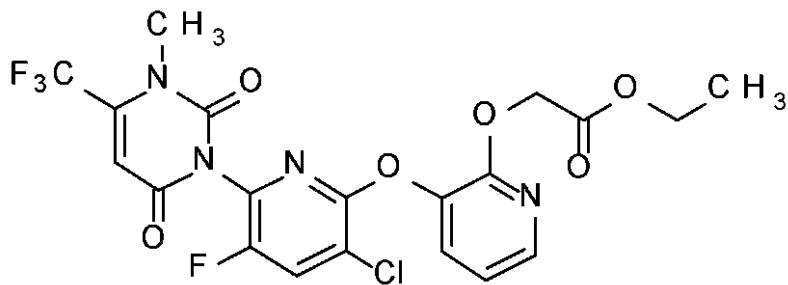
20

30

40

50

【化92】



10

【0816】

23g(46mmol)の粗製化合物7.3のDMF(500mL)の溶液に、0℃で、38g(275mmol)のK₂CO₃、次いで26.6g(187mmol)のヨウ化メチルを加えた。この反応混合物を室温で16時間、攪拌し、次に、38g(275mmol)のK₂CO₃を再度、加え、次いで26.6g(187mmol)のヨウ化メチルを加え、この混合物を室温で48時間、再度、攪拌した。この混合物を水に注ぎ入れ、酢酸エチルで抽出し、合わせた有機層を水及びブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄により脱水し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。逆相分取HPLC(アセトニトリル/水(トリフルオロ酢酸を含有))により粗生成物を精製して、10.3g(19.9mmol、43%)の所望の生成物であるエチル2-[[3-[[3-クロロ-5-フルオロ-6-[3-メチル-2,6-ジオキソ-4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-1-イル]-2-ピリジル]オキシ]-2-ピリジル]オキシ]アセテートを得た。

20

¹H-NMR (CDCl₃, ppm): 7.96 (d, J=3.97 Hz, 1H); 7.76 (d, J=7.50 Hz, 1H); 7.49 (d, J=7.06 Hz, 1H); 6.95 (dd, J=7.50 Hz, J=5.29 Hz, 1H); 6.26 (s, 1H); 4.79 (s, 2H); 4.19 (q, J=7.06 Hz, 2H); 3.48 (s, 3H); 1.24 (t, J=7.06 Hz, 3H).

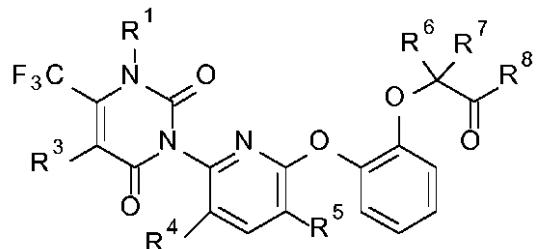
[M+H]⁺ = 519.0; Rt = 1.183分

【0817】

以下の表4～9にリスト化合物を上記の実施例と同様に調製することができる。

【0818】

【化93】



式中、R²はCF₃であり、nは1であり、
Q、W、X及びYはOであり、ZはZ¹であり、
式中、R^a、R^b、R^c及びR^dはHである

30

【0819】

40

50

【表10】

表4

no	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	m/z [M+H]	R _f [分]
8	CH ₃	H	H	Cl	H	H	OH	472	1.015
9	CH ₃	H	H	Cl	H	H	OCH ₃	486	1.11
10	CH ₃	H	H	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₃	500	1.197
11	CH ₃	H	F	F	H	H	OH	474	1.004
12	CH ₃	H	F	F	H	H	OCH ₃	488	1.167
13	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHCH ₂ (CO)OCH ₃	561	1.086
14	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHCH ₂ CH ₂ (CO)OCH ₃	575	1.094
15	CH ₃	H	F	Cl	CH ₃ (S)	H	OCH ₂ CH ₃	532	1.306
16	CH ₃	H	F	Cl	CH ₃ (R)	H	OCH ₂ CH ₃	532	1.306
17	CH ₃	H	F	CN	H	H	OCH ₂ CH ₃	509	1.212
18	CH ₃	H	H	Cl	OCH ₃	H	OCH ₃	516	1.155
19	CH ₃	H	H	Cl	CH ₃ (S)	H	OCH ₂ CH ₃	514	1.241
20	CH ₃	H	H	Cl	CH ₃ (R)	H	OCH ₂ CH ₃	514	1.241
21	CH ₃	H	F	F	OCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	532	1.214
22	CH ₃	H	F	F	CH ₃ (S)	H	OCH ₂ CH ₃	516	1.241
23	CH ₃	H	F	F	CH ₃ (R)	H	OCH ₂ CH ₃		
24	CH ₃	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	532	1.266
25	CH ₃	H	F	Cl	F	H	OCH ₂ CH ₃	536	1.287
26	CH ₃	H	F	Cl	F	CH ₃	OCH ₃	536	1.242
27	CH ₃	H	F	Cl	F	F	OCH ₂ CH ₃	554	1.239
28	CH ₃	H	F	Cl	SCH ₃	H	OCH ₃		

10

20

30

40

50

no	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	m/z [M+H]	R _t [分]
29	CH ₃	H	F	Cl	SCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	550	1.248
30	CH ₃	H	F	Cl	CH ₂ OCH ₃	H	OCH ₃	548	1.195
31	CH ₃	H	F	Cl	CO ₂ CH ₂ CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	590	1.324
32	CH ₃	H	Cl	Cl	H	H	OCH ₃		
33	CH ₃	H	Cl	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₃	534	1.270
34	CH ₃	H	H	Br	H	H	OCH ₂ CH ₃	544	1.199
35	CH ₃	H	F	Br	H	H	OCH ₂ CH ₃	564	1.247
36	CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃	534	1.300
37	CH ₃	H	F	CF ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃		
38	CH ₃	H	H	NO ₂	H	H	OCH ₂ CH ₃	511	1.165
39	CH ₃	H	F	NO ₂	H	H	OCH ₂ CH ₃		
40	CH ₃	H	H	NH ₂	H	H	OCH ₂ CH ₃	481	1.068
41	NH ₂	H	F	Cl	H	H	OCH ₃		
42	NH ₂	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₃	519	1.172
43	CD ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₃	521	1.229
44	H	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₃	504	1.180
45	CH ₃	CH ₃	F	Cl	H	H	OCH ₃		
46	CH ₃	CH ₃	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₃	532	1.294
47	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₃	504	1.186
48	CH ₃	H	F	Cl	H	H	SCH ₃	520	1.278
49	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ C≡CH	528	1.209
50	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH=CH ₂	530	1.251
51	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ C≡CCH ₃	542	1.288
52	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	544	1.334
53	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	532	1.319
54	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH(CH ₃) ₂	532	1.312
55	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OC(CH ₃) ₃		
56	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂	546	1.368
57	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	552	1.242
58	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CCl ₂ H	588	1.326
59	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CF ₂ H	554	1.226
60	CH ₃	H	F	Cl	H	H	O-c-C ₃ H ₅		
61	CH ₃	H	F	Cl	H	H	O-c-C ₄ H ₇	544	1.335
62	CH ₃	H	F	Cl	H	H	O-c-C ₅ H ₉	558	1.370
63	CH ₃	H	F	Cl	H	H	O-c-C ₆ H ₁₁	572	1.418
64	CH ₃	H	F	Cl	H	H	O-フェニル	566	1.339
65	CH ₃	H	F	Cl	H	H	O(オキセタン-3-イル)	546	1.179
66	CH ₃	H	F	Cl	H	H	O(テトラヒドロ-4-イル)	574	1.234
67	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ -c-C ₃ H ₅	544	1.283
68	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ -c-C ₄ H ₇	558	1.349
69	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ (フェニル)	580	1.322
70	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ (フラン-2-イル)	570	1.290

10

20

30

40

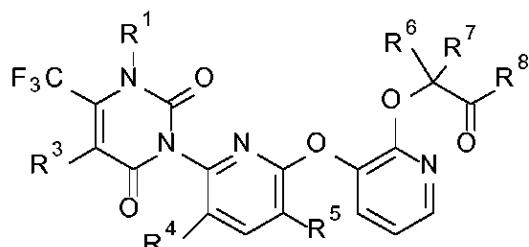
50

no	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	m/z [M+H]	R _t [分]
71	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	548	1.187
72	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	562	1.234
73	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	576	1.277
74	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	562	1.253
75	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH(OCH ₃) ₂	600*	1.216
76	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH(OCH ₂ CH ₃) ₂	628*	1.302
77	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CO ₂ CH ₃	562	1.182
78	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH(CH ₃)CO ₂ CH ₃	576	1.257
79	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	576	1.228
80	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CO ₂ CH(CH ₃) ₂	590	1.272
81	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHCH ₃	503	1.125
82	CH ₃	H	F	Cl	H	H	N(CH ₃) ₂	517	1.135
83	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHOH	505	0.996
84	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHOCH ₃	519	1.096
85	CH ₃	H	F	Cl	H	H	N(CH ₃)OCH ₃	533	1.162
86	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHCH ₂ C≡CH	527	1.153
87	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	589	1.159
88	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂		
89	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂	596	1.165
90	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHSO ₂ N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂		

*[M+Na]

【0 8 2 0】

【化94】



(I),

式中、R²はCF₃であり、nは1であり、
Q、W、X及びYはOであり、ZはZ⁷であり、
式中、R^a、R^b及びR^cはHである

【0 8 2 1】

10

20

30

40

50

【表 1 1】

表5

no	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	m/z [M+H]	Rt [分]
91	CH ₃	H	F	Cl	H		OH	491	1.052
92	NH ₂	H	F	Cl	H	H	OCH ₃		
93	NH ₂	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₃	520	1.156
94	CD ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₃	522	1.215
95	CH ₂ C≡CH	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₃	543	1.215
96	CH ₃	CH ₃	F	Cl	H	H	OCH ₃		
97	CH ₃	CH ₃	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₃	533	1.269
98	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHCH ₂ (CO)OCH ₃		
99	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHCH ₂ CH ₂ (CO)OCH ₃		
100	CH ₃	H	F	Cl	CH ₃ (S)	H	OCH ₂ CH ₃		

10

20

30

40

50

no	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	m/z [M+H]	RI [分]
101	CH ₃	H	F	Cl	CH ₃ (R)	H	OCH ₂ CH ₃		
102	CH ₃	H	F	CN	H	H	OCH ₂ CH ₃		
103	CH ₃	H	H	Cl	CH ₃ (S)	H	OCH ₂ CH ₃		
104	CH ₃	H	H	Cl	CH ₃ (R)	H	OCH ₂ CH ₃		
105	CH ₃	H	F	F	H	H	OCH ₂ CH ₃	503	1.171
106	CH ₃	H	F	F	CH ₃ (S)	H	OCH ₂ CH ₃		
107	CH ₃	H	F	F	CH ₃ (R)	H	OCH ₂ CH ₃		
108	CH ₃	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃	OCH ₃		
109	CH ₃	H	F	Cl	F	H	OCH ₂ CH ₃		
110	CH ₃	H	F	Cl	F	CH ₃	OCH ₃		
111	CH ₃	H	F	Cl	F	F	OCH ₂ CH ₃		
112	CH ₃	H	F	Cl	SCH ₃	H	OCH ₃		
113	CH ₃	H	F	Cl	SCH ₃	H	OCH ₂ CH ₃		
114	CH ₃	H	Cl	Cl	H	H	OCH ₃		
115	CH ₃	H	Cl	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₃		
116	CH ₃	H	H	Br	H	H	OCH ₂ CH ₃		
117	CH ₃	H	F	Br	H	H	OCH ₂ CH ₃		
118	CH ₃	H	H	CF ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃		
119	CH ₃	H	F	CF ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃		
120	CH ₃	H	H	NO ₂	H	H	OCH ₂ CH ₃		
121	CH ₃	H	F	NO ₂	H	H	OCH ₂ CH ₃		
122	CH ₃	H	H	NH ₂	H	H	OCH ₂ CH ₃		
123	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₃	505	1.154
124	CH ₃	H	F	Cl	H	H	SCH ₃		
125	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ C≡CH	529	1.201
126	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH=CH ₂	531	1.226
127	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ C≡CCH ₃		
128	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	545	1.305
129	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	533	1.290
130	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH(CH ₃) ₂	533	1.282
131	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OC(CH ₃) ₃		
132	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH(CH ₃) ₂	547	1.335
133	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₂ Cl		
134	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CCl ₂ H		
135	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CF ₃ H	555	1.255
136	CH ₃	H	F	Cl	H	H	O- <i>c</i> -C ₃ H ₅		
137	CH ₃	H	F	Cl	H	H	O- <i>c</i> -C ₄ H ₇		
138	CH ₃	H	F	Cl	H	H	O- <i>c</i> -C ₅ H ₉		
139	CH ₃	H	F	Cl	H	H	O- <i>c</i> -C ₆ H ₁₁	573	1.395
140	CH ₃	H	F	Cl	H	H	O-フェニル		
141	CH ₃	H	F	Cl	H	H	O(オキセタン-3-イル)	547	1.143
142	CH ₃	H	F	Cl	H	H	O(テトラヒドロピラノ-4-イル)		

10

20

30

40

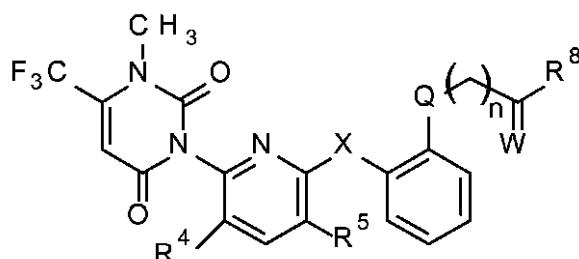
50

no	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	m/z [M+H]	Rt [分]
143	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ -c-C ₃ H ₅	545	1.257
144	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ -c-C ₄ H ₇	559	1.359
145	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ (フェニル)	581	1.330
146	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ (フラン-2-イル)		
147	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	549	1.174
148	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	563	1.228
149	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	577	1.272
150	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	563	1.217
151	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH(OCH ₃) ₂	579	1.207
152	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CH(OCH ₂ CH ₃) ₂	629*	1.305
153	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CO ₂ CH ₃		
154	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH(CH ₃)CO ₂ CH ₃	577	1.223
155	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	577	1.220
156	CH ₃	H	F	Cl	H	H	OCH ₂ CO ₂ CH(CH ₃) ₂		
157	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHCH ₃		
158	CH ₃	H	F	Cl	H	H	N(CH ₃) ₂		
159	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHOH		
160	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHOCH ₃		
161	CH ₃	H	F	Cl	H	H	N(CH ₃)OCH ₃		
162	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHCH ₂ C≡CH		
163	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃		
164	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHSO ₂ CH ₃	568	1.052
165	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHSO ₂ CH(CH ₃) ₂	596	1.126
166	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHSO ₂ N(CH ₃) ₂		
167	CH ₃	H	F	Cl	H	H	NHSO ₂ N(CH ₃)CH(CH ₃) ₂		

*[M+Na]

【0 8 2 2】

【化95】



(I),
式中、R¹はCH₃であり、R²はCF₃であり、
R³、R⁶及びR⁷はHであり、Y¹はOであり、
Z¹はZ²であり、式中、R^a、R^b、R^c及びR^dはHである

【0 8 2 3】

10

20

30

40

50

【表 1 2】

表6

no	R ⁴	R ⁵	n	X	Q	W	n	R ⁸	m/z [M+H]	Rt [分]
168	H	Cl	1	S	O	O	1	OCH ₃		
169	H	Cl	1	S	O	O	1	OCH ₂ CH ₃	516	1.222
170	F	F	1	S	O	O	1	OCH ₃		
171	F	F	1	S	O	O	1	OCH ₂ CH ₃		
172	F	Cl	1	S	O	O	1	OCH ₃		

10

173	F	Cl	1	S	O	O	1	OCH ₂ CH ₃		
174	F	Cl	1	O	O	S	1	OCH ₃		
175	F	Cl	1	O	O	S	1	OCH ₂ CH ₃		
176	F	Cl	1	O	NH	O	1	OCH ₃		
177	F	Cl	1	O	NH	O	1	OCH ₂ CH ₃		
178	F	Cl	1	O	NCH ₃	O	1	OCH ₃		
179	F	Cl	1	O	NCH ₃	O	1	OCH ₂ CH ₃	531	1.280
180	F	Cl	1	O	S	O	1	OCH ₃		
181	F	Cl	1	O	S	O	1	OCH ₂ CH ₃		
182	F	Cl	1	O	SO	O	1	OCH ₃		
183	F	Cl	1	O	SO	O	1	OCH ₂ CH ₃		
184	F	Cl	1	O	SO ₂	O	1	OCH ₃		
185	F	Cl	1	O	SO ₂	O	1	OCH ₂ CH ₃		
186	F	Cl	1	O	CH ₂	O	1	OCH ₃	502	1.243
187	F	Cl	1	O	CH ₂	O	1	OCH ₂ CH ₃		
188	F	Cl	2	O	NH	O	2	OCH ₃		
189	F	Cl	2	O	NH	O	2	OCH ₂ CH ₃		
190	F	Cl	2	O	NCH ₃	O	2	OCH ₃		
191	F	Cl	2	O	NCH ₃	O	2	OCH ₂ CH ₃		
192	F	Cl	2	O	CH ₂	O	2	OCH ₃		
193	F	Cl	2	O	CH ₂	O	2	OCH ₂ CH ₃		
194	F	Cl	3	O	O	O	3	OCH ₃		
195	F	Cl	3	O	O	O	3	OCH ₂ CH ₃	546	1.300

20

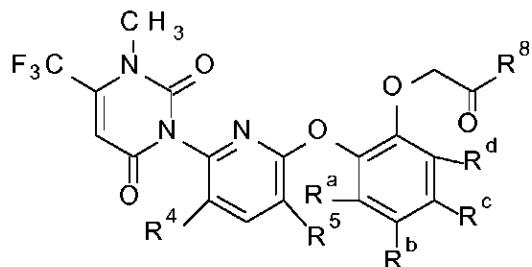
30

40

【0 8 2 4】

50

【化96】



(I),
式中、R¹はCH₃であり、R²はCF₃であり、
R³、R⁶及びR⁷はHであり、nは1であり、
Q、W、X及びYはOであり、ZはZ¹である

【0825】

【表13】

表7

no	R ⁴	R ⁵	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ⁸	m/z [M+H]	Rt [分]
196	F	Cl	F	H	H	H	OCH ₃		
197	F	Cl	F	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	536	1.230
198	F	Cl	H	F	H	H	OCH ₃		
199	F	Cl	H	F	H	H	OCH ₂ CH ₃	536	1.258
200	F	Cl	H	H	F	H	OCH ₃		
201	F	Cl	H	H	F	H	OCH ₂ CH ₃	536	1.258
202	F	Cl	H	H	H	F	OCH ₃		
203	F	Cl	H	H	H	F	OCH ₂ CH ₃	536	1.240
204	F	Cl	Cl	H	H	H	OCH ₃		
205	F	Cl	Cl	H	H	H	OCH ₂ CH ₃		

10

20

30

40

50

no	R ⁴	R ⁵	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ⁸	m/z [M+H]	Rt [分]
206	F	Cl	H	Cl	H	H	OCH ₃		
207	F	Cl	H	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₃	552	1.303
208	F	Cl	H	H	Cl	H	OCH ₃		
209	F	Cl	H	H	Cl	H	OCH ₂ CH ₃		
210	F	Cl	H	H	H	Cl	OCH ₃		
211	F	Cl	H	H	H	Cl	OCH ₂ CH ₃		
212	F	Cl	CH ₃	H	H	H	OCH ₃		
213	F	Cl	CH ₃	H	H	H	OCH ₂ CH ₃		
214	F	Cl	H	CH ₃	H	H	OCH ₃		
215	F	Cl	H	CH ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃		
216	F	Cl	H	H	CH ₃	H	OCH ₃		
217	F	Cl	H	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃		
218	F	Cl	H	H	H	CH ₃	OCH ₃		
219	F	Cl	H	H	H	CH ₃	OCH ₂ CH ₃		
220	F	Cl	CF ₃	H	H	H	OCH ₃		
221	F	Cl	CF ₃	H	H	H	OCH ₂ CH ₃		
222	F	Cl	H	CF ₃	H	H	OCH ₃		
223	F	Cl	H	CF ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃		
224	F	Cl	H	H	CF ₃	H	OCH ₃		
225	F	Cl	H	H	CF ₃	H	OCH ₂ CH ₃	586	1.331
226	F	Cl	H	H	H	CF ₃	OCH ₃		
227	F	Cl	H	H	H	CF ₃	OCH ₂ CH ₃		

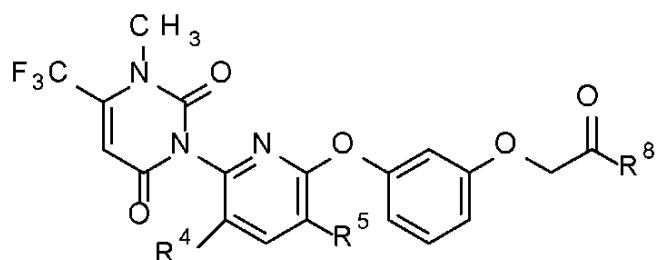
10

20

30

【0826】

【化97】



(I),
式中、R¹はCH₃であり、R²はCF₃であり、
R³、R⁶及びR⁷はHであり、nは1であり、
Q、W、X及びYはOであり、ZはZ²であり、
式中、R^a、R^b及びR^cはHである

40

【0827】

【表14】

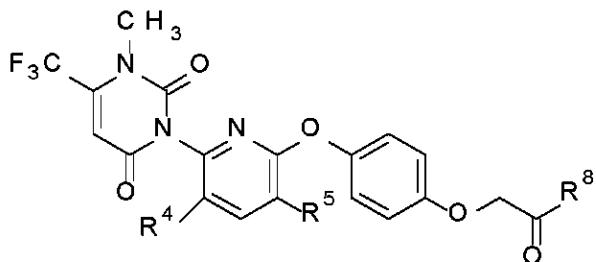
表8

no	R ⁴	R ⁵	R ⁸	m/z [M+H]	Rt [分]
228	F	Cl	OCH ₂ CH ₃	518	1.267

【0828】

50

【化98】



(I),
式中、R¹はCH₃であり、R²はCF₃であり、
R³、R⁶及びR⁷はHであり、nは1であり、
Q、W、X及びYはOであり、ZはZ³であり、
式中、R^a、R^b及びR^cはHである

10

【0829】

【表15】

表9

no	R ⁴	R ⁵	R ⁸	m/z [M+H]	Rt [分]
229	F	Cl	OCH ₂ CH ₃	518	1.256

【0830】

B 使用実施例

式(I)のウラシルピリジンの除草活性を、以下の温室実験によって示した:

20

【0831】

使用した培養容器は、培養土として約3.0%の腐食質を含むローム砂を入れたプラスチック製植木鉢であった。試験植物の種子を、各種毎に別々に播種した。

【0832】

出芽前処理については、水に懸濁又は乳化させた活性成分を、微分配ノズルを用いて播種後に直接施用した。発芽及び生育を促進するため容器に静かに灌水し、その後、植物が根付くまで透明なプラスチック製フードで覆った。このカバーは、それが活性成分によって損なわれない限り、試験植物の一様な発芽をもたらした。

【0833】

出芽後処理については、最初に、試験植物をその生息地に応じて3~15cmの高さまで生育させ、その後初めて水に懸濁又は乳化させた活性成分で処理した。この目的のため、試験植物を直接播種して同じ容器中で生育させるか、又はこれらの試験植物を最初に実生として別々に生育させ、処理の数日前に試験容器に移植した。

30

【0834】

植物を、その種に応じてそれぞれ10~25 又は20~35 で保持した。

【0835】

試験期間は、2~4週間にわたった。この期間中、植物の世話をし、個々の処理に対するそれらの反応について評価した。

【0836】

評価は0~100のスケールを用いて行った。100は、植物の出芽なし、又は少なくとも空中部分の完全な破壊を意味し、0は、損傷なし、又は正常な生育過程を意味する。優れた除草活性は70以上の値で示され、極めて優れた除草活性は85以上の値で示される。

40

【0837】

温室実験に使用した植物は、以下の種の植物であった:

【0838】

50

【表 1 6】

バイエルコード	学名
ALOMY	ノスズメノテッポウ (Alopecurus myosuroides)
AMARE	アオゲイトウ (Amaranthus retroflexus)
BRADC	ブラキアリア・デクムベンス (Brachiaria decumbens)
CHEAL	シロザ (Chenopodium album)
ECHCG	イヌビエ (Echinocloa crus-galli)
LOLMU	イタリアンライグラス (Lolium multiflorum)
MATCH	カミツレ(Matricaria chamomilla)
SETVI	エノコログサ(Setaria viridis)
ZEAMX	トウモロコシ(Zea mays)

10

【0 8 3 9】

16g/haの施用量で、出芽後法により施用された、化合物1、2、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、20、21、22、24、25、26、27、33、34、35、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、61、62、63、64、65、66、67、68、69、70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、80、83、84、85、86、89、91、97、125、126、128、129、130、132、135、143、145、147、149、150、151、152、154、165、169、199、201、207、228及び229は、AMARE、CHEAL、ECHCG及びSETVIに対して非常に良好な除草活性を示した。

20

【0 8 4 0】

16g/haの施用量では、出芽後法により施用した、化合物18、82、87及び155は、AMARE、CHEAL及びSETVIに対して、非常に良好な除草活性を示した。

【0 8 4 1】

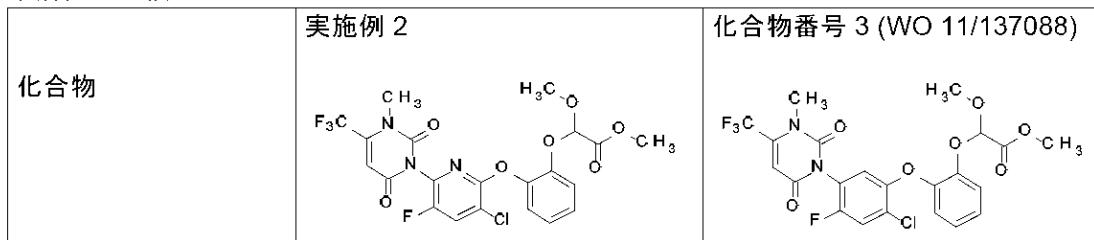
30

40

50

【表 17】

表 10:出芽後(温室)の本発明の実施例 2 と WO11/137088 から公知の化合物番号 3 との除草活性の比較



10

施用量 [g/ha]	8	8
不要な植物		損傷
ALOMY	70	40
LOLMU	70	40
MATCH	70	60

20

施用量 [g/ha]	2	2
不要な植物		損傷
BRADC	80	20
作物植物	25	40
ZEAMX		

20

施用量 [g/ha]	1	1
不要な植物		損傷
CHEAL	90	45

【0842】

これらのデータは、本発明の式Iである発明化合物は、従来技術から公知の化合物よりも優れた除草活性があることを明確に実証している。

【0843】

ピリジン環による中央のフェニル環への置換により、一層優れた除草活性がもたらされるだけではなく、WO 11/137088から公知の化合物によって達成されるものよりもかなり優れた作物適合性がもたらされる。

30

【0844】

式(I)の化合物による耐性雑草の防除を、以下の温室実験によって実証した:

【0845】

使用した培養容器は、培養土として約3.0%の腐食質を含むローム砂を入れたプラスチック製植木鉢であった。試験植物の種子を、各種及び/又は耐性バイオタイプに別々に播種した。出芽前処理については、水に懸濁又は乳化させた活性成分を、微分配ノズルを用いて播種後に直接施用した。発芽及び生育を促進するため容器に静かに灌水し、その後、植物が根付くまで透明なプラスチック製フードで覆った。このカバーは、それが活性成分によって損なわれない限り、試験植物の一様な発芽をもたらした。出芽後処理については、最初に、試験植物をその植物生息地に応じて3~15cmの高さまで生育させ、その後初めて水に懸濁又は乳化させた活性成分で処理した。この目的のため、試験植物を直接播種して同じ容器内で生育させるか、又はこれらの試験植物を最初に実生として別々に生育させ、処理の数日前に試験容器に移植した。植物を、その種に応じてそれぞれ10~25 又は20~35 で保持した。試験期間は、2~4週間にわたった。この期間中、植物の世話をし、個々の処理に対するそれらの反応について評価した。評価は、0~100のスケールを用いて行った。100は、植物の出芽なし、又は少なくとも地上部の完全な破壊を意味し、0は、損傷なし、又は正常な生育過程を意味する。

40

【0846】

50

温室実験に使用した植物は、以下の種及びバイオタイプであった：

【0847】

【表18】

雑草番号	バイエルコード	学芸名	一般名	バイオタイプ
w.1	AMATA	ナガホアオビュ (Amaranthus tamariscinus)	タリホノア オゲイトウ (common waterhemp)	感受性
w.2	AMATA	ナガホアオビュ	タリホノア オゲイトウ	△G210 変異を含有することが示 された PPO 耐性バイオタイプ 1
w.3	AMATA	ナガホアオビュ	タリホノア オゲイトウ	△G210 変異を含有することが示 された PPO 耐性バイオタイプ 2

10

【0848】

以下の表に示されているこれらの結果は、化合物7及び化合物1が、感受性(w.1)雑草及び△G210変異(w.2、w.3)を含有する耐性雑草の両方に対して非常に良好な活性を示す一方、公知のPPO阻害剤であるアザフェニジンは、感受性バイオタイプに比べて、耐性の防除がかなり弱いことを示すことを実証している。

【0849】

20

【表19】

除草剤化合物	使用量	雑草防除(%)		
		w.1	w.2	w.3
1	4 g/ha	100	100	100
1	2 g/ha	88	87	98
7	4 g/ha	100	100	100
7	2 g/ha	93	100	100
アザフェニジン	4 g/ha	100	78	77
アザフェニジン	2 g/ha	88	62	77

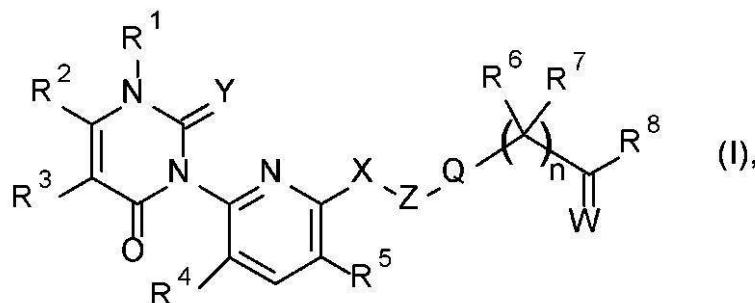
30

本発明の実施形態として例えば以下を挙げることができる。

【実施形態1】

式(I)

【化99】



40

【式中、可変要素は、以下の意味を有する：

R¹は、水素、NH₂、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-アルキニルであり；

R²は、水素、C₁-C₆-アルキル又はC₁-C₆-ハロアルキルであり；

R³は、水素又はC₁-C₆-アルキルであり；

R⁴は、H又はハロゲンであり；

R⁵は、ハロゲン、CN、NO₂、NH₂、CF₃又はC(=S)NH₂であり；

R⁶は、H、ハロゲン、CN、C₁-C₃-アルキル、C₁-C₃-ハロアルキル、C₁-C₃-アルコキシ、

50

C₁-C₃-ハロアルコキシ、C₁-C₃-アルキルチオ、(C₁-C₃-アルキル)アミノ、ジ(C₁-C₃-アルキル)アミノ、C₁-C₃-アルコキシ-C₁-C₃-アルキル、又はC₁-C₃-アルコキシカルボニルであり：

R⁷は、H、ハロゲン、C₁-C₃-アルキル、又はC₁-C₃-アルコキシであり；

R⁸は、OR⁹、SR⁹、NR¹⁰R¹¹、NR⁹OR⁹、NR⁹S(O)₂R¹⁰又はNR⁹S(O)₂NR¹⁰R¹¹であり

R⁹は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₆-ハロアルケニル、C₃-C₆-ハロアルキニル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルコキシ)C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ハロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルホニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニルオキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルキニルオキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、アミノ、(C₁-C₆-アルキル)アミノ、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ、(C₁-C₆-アルキルカルボニル)アミノ、アミノ-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、

-N=CR¹²R¹³(R¹²及びR¹³は、互いに独立して、H、C₁-C₄-アルキル又はフェニルである)、

C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ヘテロシクリル、C₃-C₆-ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル、フェニル、フェニル-C₁-C₄-アルキル又は5員若しくは6員のヘテロアリールであり、

シクロアルキル環、ヘテロシクリル環、フェニル環又はヘテロアリール環はそれぞれ、R¹⁴から選択される1~4個の置換基又は3~7員の炭素環により置換されていてもよく、

この炭素環は、炭素原子に加えて、-N(R¹²)-、-N=N-、-C(=O)-、-O-及び-S-からなる群から選択される1又は2個の環員を場合により有しており、

この炭素環は、R¹⁴から選択される1~4個の置換基により場合により置換されており、

R¹⁴は、ハロゲン、NO₂、CN、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ又はC₁-C₄-アルコキシカルボニルであり、

R¹⁰、R¹¹は、互いに独立して、R⁹であるか、又は一緒になって3~7員の炭素環を形成し、

この炭素環は、炭素原子に加えて、-N(R¹²)-、-N=N-、-C(=O)-、-O-及び-S-からなる群から選択される1又は2個の環員を場合により有しており、

この炭素環は、R¹⁴から選択される1~4個の置換基により場合により置換されており、nは、1~3であり：

Qは、CH₂、O、S、SO、SO₂、NH又は(C₁-C₃-アルキル)Nであり；

Wは、O又はSであり：

Xは、NH、NCH₃、O又はSであり：

Yは、O又はSであり：

Zは、それぞれ、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、及びC₁-C₆-ハロアルコキシからなる群から選択される、1~4個の置換基により場合により置換されている、フェニル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル又はピラジニルである】

のウラシルピリジン(それらの農業上許容可能な塩又は誘導体を含む)

であって、但し、式(I)の化合物がカルボキシル基を有することを条件とする、式(I)のウラシルピリジン。

10

20

30

40

50

[実施形態 2]

R¹が、C₁-C₆-アルキルであり、R²が、C₁-C₄-ハロアルキルであり、R³がHであり、Yが、Oである、実施形態1に記載の式(I)のウラシルピリジン。

[実施形態 3]

R⁴が、H又はFであり、R⁵が、F、Cl、Br又はCNである、実施形態1又は2に記載の式(I)のウラシルピリジン。

[実施形態 4]

R⁶が、H、C₁-C₃-アルキル又はC₁-C₃-アルコキシであり、R⁷がHである、実施形態1から3のいずれかに記載の式(I)のウラシルピリジン。

[実施形態 5]

R⁸が、OR⁹、NR⁹S(O)₂R¹⁰又はNR⁹S(O)₂NR¹⁰R¹¹であり、

R⁹が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ジ(C₁-C₆-アルコキシ)C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキルであり、

R¹⁰、R¹¹が、C₁-C₆-アルキルである、

実施形態1から4のいずれかに記載の式(I)のウラシルピリジン。

[実施形態 6]

nが1である、実施形態1から5のいずれかに記載の式(I)のウラシルピリジン。

[実施形態 7]

Q、W及びXがOである、実施形態1から6のいずれかに記載の式(I)のウラシルピリジン。

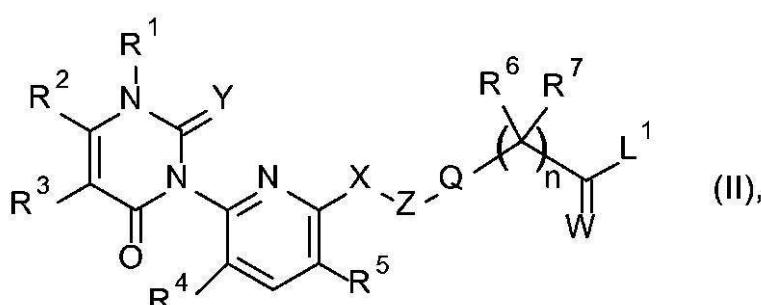
[実施形態 8]

Zが、フェニル又はピリジルであり、これらがそれぞれ、ハロゲン、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ及びC₁-C₆-ハロアルコキシからなる群から選択される、1~4個の置換基により場合により置換されている、実施形態1から7のいずれかに記載の式(I)のウラシルピリジン。

[実施形態 9]

式(II)

【化100】



(式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、n、Q、W、X、Y及びZは、実施形態1から8のいずれかに定義されているとおりであり、

L¹は、ハロゲンである)

の酸ハロゲン化物。

[実施形態 10]

式(int-1)

10

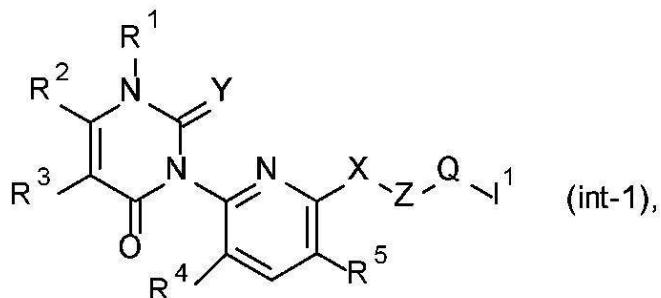
20

30

40

50

【化101】



10

(式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、Q、X、Y及びZは、実施形態1から8のいずれかに定義されているとおりであり、

L¹は、H又はPGであり、PGは、

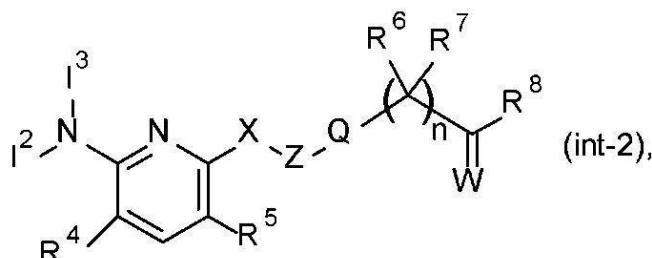
C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキオキシ-C₁-C₄-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シルクロアルキル-C₁-C₄-アルキル、C₅-C₆-シクロアルケニル、テトラヒドロピラニル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル、ホルミル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル、C₁-C₆-アルキル-O-カルボニル、C₂-C₆-アルケニル-O-カルボニル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル-C₁-C₄-アルキル、フェニル-C₁-C₄-アルキル、フェニルチオ-C₁-C₆-アルキル、及びフェニルカルボニルからなる群から選択される保護基であり、

フェニル環はそれぞれ、ハロゲン、CN、NO₂、C₁-C₄-アルキル及びC₁-C₄-アルコキシからなる群から選択される1~3個の置換基により置換されていてもよい)の中間体(それらの塩を含む)。

【実施形態11】

式(int-2)

【化102】



30

(式中、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、n、Q、W、X、Y及びZは、実施形態1から8のいずれかに定義されているとおりであり、

L²は、Hであり、

L³は、H又はC(=Y)L²であり、

Yは、O又はSであり、

L²は、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ又はアリールオキシ(アリール部分は、それ自体、部分的に若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、並びに/又はシアノ、ニトロ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-アルキルチオからなる群からの1~3個の置換基により置換されていてもよい)であるか、

又はL²とL³は、それらが結合しているN原子と一緒にになって、基「YCN」(YはO又はSである)、

又は基「PGN」(これは、N₃、脂肪族又は芳香族カルバメート、脂肪族又は芳香族アミド、N-C₁-C₆-アルキル-アミン、N-アリール-アミン又はヘテロアリールアミドからなる群

40

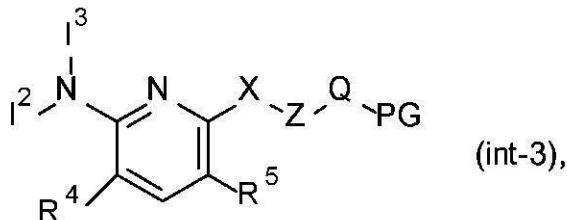
50

から選択される、保護アミン置換基である)を形成する]の中間体(それらの塩を含む)。

[実施形態 12]

式(int-3)

【化 103】



[式中、R⁴、R⁵、Q、X及びZは、実施形態1から8のいずれかに定義されているとおりであり、PGは、

C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル-C₁-C₄-アルキオキシ-C₁-C₄-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シルクロアルキル-C₁-C₄-アルキル、C₅-C₆-シクロアルケニル、テトラヒドロピラニル、(トリ-C₁-C₆-アルキル)シリル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル、ホルミル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル、C₁-C₆-アルキル-O-カルボニル、C₂-C₆-アルケニル-O-カルボニル、[(ジフェニル)(C₁-C₄-アルキル)]シリル-C₁-C₄-アルキル、フェニル-C₁-C₄-アルキル、フェニルチオ-C₁-C₆-アルキル、及びフェニルカルボニルからなる群から選択される保護基であり、

フェニル環はそれぞれ、ハロゲン、CN、NO₂、C₁-C₄-アルキル及びC₁-C₄-アルコキシからなる群から選択される1~3個の置換基により置換されていてもよく、

L²は、Hであり、

L³は、H又はC(=Y)L²であり、

Yは、O又はSであり、

L²は、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ又はアリールオキシ(アリール部分は、それ自体、部分的に若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、並びに/又はシアノ、ニトロ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-アルキルチオからなる群からの1~3個の置換基により置換されていてもよい)であるか、

又はL²とL³は、それらが結合しているN原子と一緒にになって、基「YCN」(YはO又はSである)、

又は基「PGN」(これは、N₃、脂肪族又は芳香族カルバメート、脂肪族又は芳香族アミド、N-C₁-C₆-アルキル-アミン、N-アリール-アミン又はヘテロアリールアミドからなる群から選択される、保護アミン置換基である)を形成する]の中間体(それらの塩を含む)。

[実施形態 13]

除草活性量の少なくとも1種の実施形態1に記載される式(I)のウラシルピリジン、並びに少なくとも1種の不活性液体担体及び/又は不活性固体担体、並びに適切である場合、少なくとも1種の界面活性物質を含む除草組成物。

[実施形態 14]

除草活性量の少なくとも1種の実施形態1に記載の式(I)のウラシルピリジン、並びに少なくとも1種の不活性液体担体及び/又は不活性固体担体、並びに所望の場合、少なくとも1種の界面活性物質を含む除草活性組成物の調製方法。

[実施形態 15]

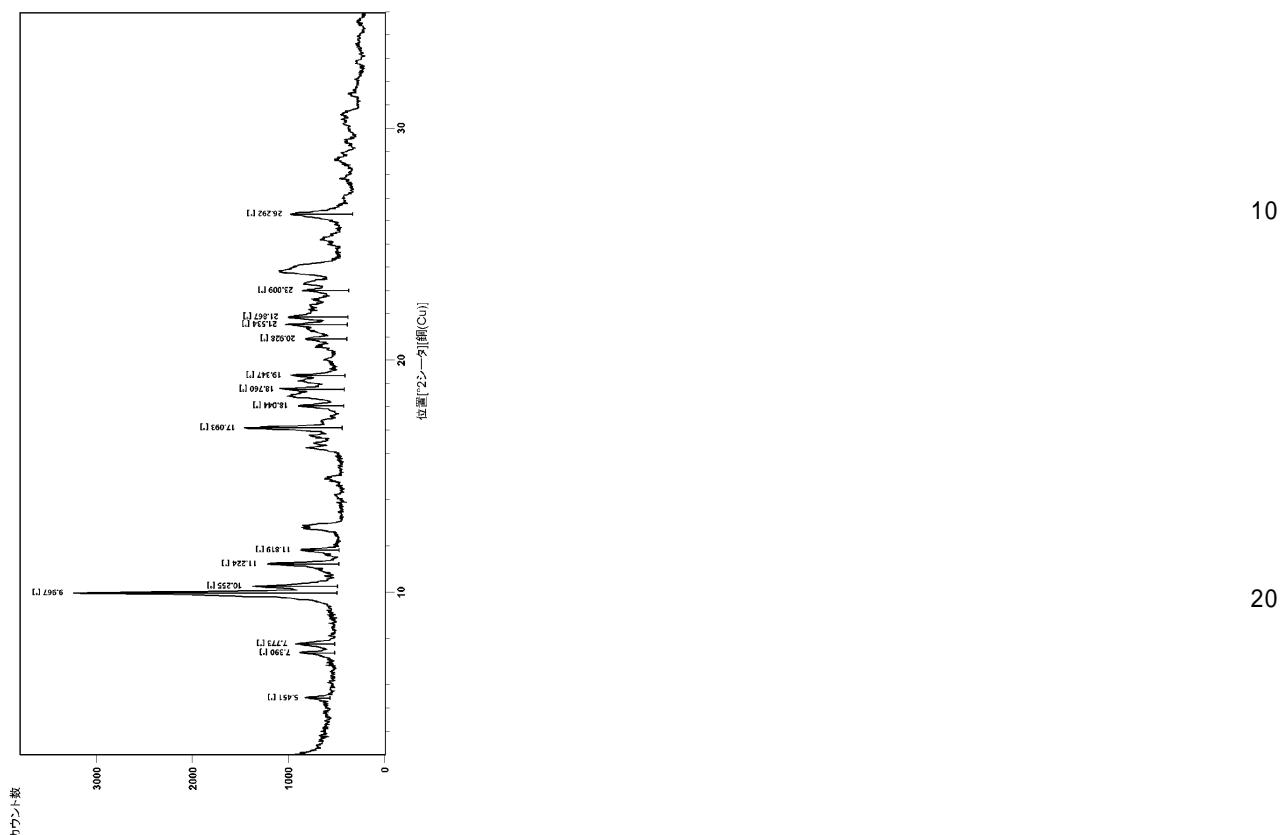
除草活性量の少なくとも1種の実施形態1に記載の式(I)のウラシルピリジンを、植物、それらの環境又は種子に作用させるステップを含む、望ましくない植生を防除する方法。

[実施形態 16]

除草剤としての、実施形態1に記載の式(I)のウラシルピリジンの使用。

【図面】

【図 1】



30

40

50

フロントページの続き

ガーホフ, シュパイヤー シュトラーセ 2
(72)発明者 ヴィッツシェル, マティアス
ドイツ連邦共和国 6 7 0 5 6 ルートヴィヒスハーフェン, カール - ポッシュ - シュトラーセ 3 8

ヨハネス, マヌエル
(72)発明者 ドイツ連邦共和国 4 0 2 2 5 デュッセルドルフ, モーリッツ - ゾマー - シュトラーセ 1 2 アー
マッサ, ダリオ
ドイツ連邦共和国 6 7 1 1 7 リンブルガーホフ, シュパイヤー シュトラーセ 2

パラ ラパド, リリアナ
(72)発明者 ドイツ連邦共和国 6 7 1 1 7 リンブルガーホフ, シュパイヤー シュトラーセ 2

アポンテ, ラファエル
(72)発明者 アメリカ合衆国 2 7 7 0 9 ノースカロライナ州, リサーチ トライアングル パーク, デイビス
ドライブ 2 6

ミーツナー, トーマス
(72)発明者 ドイツ連邦共和国 6 7 0 5 6 ルートヴィヒスハーフェン, カール - ポッシュ - シュトラーセ 3 8

ニュートン, トレヴァー ウィリアム
(72)発明者 ドイツ連邦共和国 6 7 1 1 7 リンブルガーホフ, シュパイヤー シュトラーセ 2

ザイツ, トーマス
(72)発明者 ドイツ連邦共和国 6 7 0 5 6 ルートヴィヒスハーフェン, カール - ポッシュ - シュトラーセ 3 8

エバンス, リチャード アール
アメリカ合衆国 2 7 6 1 3 ノースカロライナ州, ダーラム, レイクウッド ドライブ 8 4 1 2

ランデス, アンドレアス
(72)発明者 ドイツ連邦共和国 6 7 1 1 7 リンブルガーホフ, シュパイヤー シュトラーセ 2

審査官 柳本 航佑
(56)参考文献 国際公開第 2 0 1 1 / 1 3 7 0 8 8 (WO, A 1)
国際公開第 9 9 / 0 5 2 8 9 2 (WO, A 1)
欧州特許出願公開第 0 2 3 9 4 9 9 3 (E P, A 1)
国際公開第 2 0 1 4 / 1 8 7 2 9 7 (WO, A 1)
国際公開第 0 2 / 0 9 8 2 2 7 (WO, A 1)
国際公開第 9 8 / 0 2 7 0 8 2 (WO, A 1)
国際公開第 2 0 1 7 / 0 2 7 3 5 9 (WO, A 1)
WANG, X et al., Synthesis and biological evaluation of N-alkyl-N-(4-methoxyphenyl)pyridin-2-amines as a new class of tubulin polymerization inhibitors, Bioorganic & Medicinal Chemistry, 2012年, Vol. 21, pp. 632-642, <http://dx.doi.org/10.1016/j.bmc.2012.11.047>
CAS REGISTRY NO. 1929837-70-6, DATABASE REGISTRY, [online], 2016年06月12日, [2021年 4月 9日検索], Retrieved from: STN
CAS REGISTRY NO. 1929793-56-5, DATABASE REGISTRY, [online], 2016年06月12日, [2021年 4月 9日検索], Retrieved from: STN
(58)調査した分野 (Int.Cl., D B名)
C 0 7 D 4 0 1 / 0 0 - 4 0 1 / 1 4
A 0 1 N 4 3 / 0 0 - 4 3 / 9 2
A 0 1 P 1 3 / 0 0
C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N)