

(19)日本国特許庁(JP)

## (12)特許公報(B2)

(11)特許番号

特許第7184813号  
(P7184813)

(45)発行日 令和4年12月6日(2022.12.6)

(24)登録日 令和4年11月28日(2022.11.28)

(51)国際特許分類

F I

C 0 7 D 207/22 (2006.01)

C 0 7 D 207/22

C S P

A 0 1 N 43/36 (2006.01)

A 0 1 N 43/36

B

A 0 1 N 43/40 (2006.01)

A 0 1 N 43/40

1 0 1 L

A 0 1 N 43/84 (2006.01)

A 0 1 N 43/84

1 0 1

A 0 1 N 47/24 (2006.01)

A 0 1 N 47/24

G

請求項の数 5 (全86頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願2019-566131(P2019-566131)

(86)(22)出願日 平成30年5月30日(2018.5.30)

(65)公表番号 特表2020-522493(P2020-522493  
A)

(43)公表日 令和2年7月30日(2020.7.30)

(86)国際出願番号 PCT/US2018/035015

(87)国際公開番号 WO2018/222646

(87)国際公開日 平成30年12月6日(2018.12.6)

審査請求日 令和3年5月25日(2021.5.25)

(31)優先権主張番号 62/512,683

(32)優先日 平成29年5月30日(2017.5.30)

(33)優先権主張国・地域又は機関  
米国(US)

(73)特許権者 391022452

エフ エム シー コーポレーション

FMC CORPORATION

アメリカ合衆国 1 9 1 0 4 ペンシルベ

ニア州 フィラデルフィア ウォールナッ

トストリート 2 9 2 9

(74)代理人 100127926

弁理士 結田 純次

(74)代理人 100140132

弁理士 竹林 則幸

(72)発明者 トラヴィス・チャンドラ ・マクマホン

アメリカ合衆国デラウェア州 1 9 7 0 9

ミドルタウン・ウィロー・グローブ・

ミル・ドライブ 8 1

審査官 阿久津 江梨子

最終頁に続く

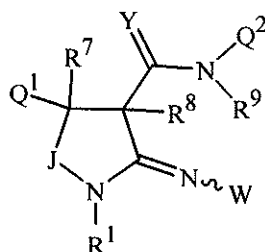
(54)【発明の名称】 除草用アミド

(57)【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 1 の化合物、その N - オキシド塩および立体異性体

【化 1】



1

(式中、

Wは、-NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>であり；R<sup>A</sup>は、H、シアノ、CHO、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル；またはハロゲンもしくはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルで置換されているまたは非置換のフェニルであり；R<sup>B</sup>は、H、シアノ、ヒドロキシ、CHO、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル

、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニルもしくは $C_3 \sim C_{10}$ トリアルキルシリルであり；または、フェニル環もしくはナフタレニル環系

10

であり、各環もしくは環系は、 $R^{16}$ から独立して選択される5個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または、 $R^{16}$ から独立して選択される5個以下の置換基で環員上で置換されているまたは非置換の4～7員複素環式環であり；または

$R^A$ および $R^B$ は、これらが両方とも結合している窒素原子と一緒にあって、炭素、酸素、窒素および $-C(=O)-$ から選択される環員を含有する4、5もしくは6員環を形成しており；または、一緒にあって6～10員二環式環系となっており；または、一緒にあって8～13員三環式環系となっており、各環もしくは環系は、炭素、窒素および $-C(=O)-$ から選択される環員を含有し、ハロゲン、シアノもしくは $C_1 \sim C_4$ アルキルで置換されているまたは非置換であり；

20

$U$ は、 $-CR^2R^3-$ 、 $-CR^2R^3-CR^4R^5-$ 、 $-NR^6-$ または $-O-$ であり；

$Y$ は、 $O$ 、 $S$ または $NR^{15}$ であり；

$R^1$ は、 $H$ 、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、 $CHO$ 、 $C_3 \sim C_8$ アルキルカルボニルアルキル、 $-C(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})=N-O(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニル、 $C_3 \sim C_{10}$ トリアルキルシリルであり；または $-CPh=N-O(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ であり、ここで、フェニルは、 $R^{13}$ から独立して選択される5個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または $G^1$ であり；

30

40

$Q^1$ は、フェニル環もしくはナフタレニル環系であり、各環もしくは環系は、 $R^{10}$ から独立して選択される5個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または、4～7員複素環式環；もしくは8～10員二環式環系であり、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに2個以下の $O$ 原子、2個以下の $S$ 原子および5個以下の $N$ 原子から独立して選択される1～5個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、3個以下の炭素環員は $C(=O)$ および $C(=S)$ から独立して選択され、硫黄原子環員は $S(=O)_u(C=N R^{14})_v$ から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で $R^{10}$ から独

50

立して選択されるおよび窒素原子環員上で  $R^{12}$  から独立して選択される 5 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；

$Q^2$  は、フェニル環もしくはナフタレニル環系であり、各環もしくは環系は、 $R^{11}$  から独立して選択される 5 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または、4 ~ 7 員複素環式環；もしくは 8 ~ 10 員二環式環系であり、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに 2 個以下の O 原子、2 個以下の S 原子および 5 個以下の N 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、3 個以下の炭素環員は  $C(=O)$  および  $C(=S)$  から独立して選択され、硫黄原子環員は  $S(=O)_u$  ( $=NR^{14}$ )<sub>v</sub> から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で  $R^{11}$  から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で  $R^{13}$  から独立して選択される 5 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；

10

$R^2$  および  $R^3$  は、それぞれ独立して H、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルもしくは  $C_1 \sim C_4$  アルコキシであり；または

$R^2$  および  $R^3$  は、これらが結合している炭素原子と一緒に becoming  $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル環を形成しており；

$R^4$  および  $R^5$  は、それぞれ独立して H、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルまたは  $C_1 \sim C_4$  アルコキシであり；

$R^6$  は、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_3 \sim C_6$  アルキニルもしくは  $C_1 \sim C_6$  アルコキシであり；または

$R^1$  および  $R^6$  は、一緒に becoming  $C_3 \sim C_6$  アルキレンもしくは  $-CH_2OCH_2-$  となっており；

20

$R^7$  および  $R^8$  は、それぞれ独立して H、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルまたは  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり；

$R^9$  は、H、ヒドロキシ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_3 \sim C_6$  アルキニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$  ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$  ジアルキルアミノスルホニルもしくは  $C_3 \sim C_{10}$  トリアルキルシリル；または  $G^1$  であり；

30

各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立してハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_1 \sim C_8$  シアノアルキル、 $C_1 \sim C_8$  シアノアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_8$  ヒドロキシアルキル、 $C_1 \sim C_8$  ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$  ニトロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$  アルキニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$  アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、シクロプロピルメチル、1 - メチルシクロプロピル、2 - メチルシクロプロピル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$  ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$  アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$  シクロアルキルアルケニル、 $C_5 \sim C_{12}$  シクロアルキルアルキニル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$  アルキルシクロアルキル、 $C_6 \sim C_{12}$  シクロアルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$  ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$  アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルス

40

50

ルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ハロジアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルアミノアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノアルキル、 $-CHO$ 、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $-C(=O)OH$ 、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $-C(=O)NH_2$ 、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルコシアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ アルキニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ ハロアルキニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ アルキルカルボニルアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニルオキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニル、ホルミルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニルアミノ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルアミノ、 $-SF_5$ 、 $-SCN$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $C_3 \sim C_{12}$ トリアルキルシリル、 $C_4 \sim C_{12}$ トリアルキルシリルアルキルもしくは $C_4 \sim C_{12}$ トリアルキルシリルアルコキシであり；または $G^2$ であり；または、 $R^{20}S(=O)=N-$ 、 $R^{20}S(=O)_2NR^{19}-C(=O)-$ もしくは $R^{20}(R^{19}N=)_qS(=O)_p-$ であり、ここで、右に突出している自由結合手は $Q^1$ への結合点を示し；

各 $R^{12}$ および $R^{13}$ は、独立してシアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ ヒドロキシアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルケニル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_3$ アルキルアミノアルキルまたは $C_3 \sim C_4$ ジアルキルアミノアルキルであり；

各 $R^{14}$ は、独立してH、シアノ、 $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_3$ ハロアルキルカルボニルであり；

$R^{15}$ は、H、シアノ、ヒドロキシ、 $CHO$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニルであり；

各 $G^1$ は、独立してフェニルであり；または5もしくは6員複素環式環であり、それぞれ $R^{17}$ から独立して選択される5個以下の置換基で環員上で置換されているまたは非置換であり；

各 $G^2$ は、独立してフェニル、フェニルメチル、ピリジニルメチル、フェニルカルボニル、フェノキシ、フェニルエチニル、フェニルスルホニル、または5もしくは6員複素環式環であり、それぞれ $R^{18}$ から独立して選択される5個以下の置換基で環員上で置換されているまたは非置換であり；

各 $R^{16}$ 、 $R^{17}$ および $R^{18}$ は、独立してハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_8$ ヒドロキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>アルキルカルボニルオキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキルアミノスルホニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>ジアルキルアミノスルホニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>トリアルキルシリル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキルアミノ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>ジアルキルアミノ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>アルキルカルボニルアミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノ、フェニル、ピリジニルまたはチエニルであり；

各 R<sup>19</sup>は、独立してH、シアノ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub>アルキルカルボニルまたはC<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub>ハロアルキルカルボニルであり；

各 R<sup>20</sup>は、独立してH、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub>シクロアルキルアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>アルコキシアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>ハロアルコキシアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>アルキルチオアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>アルキルスルフィニルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>アルキルスルホニルアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>トリアルキルシリルまたはG<sup>1</sup>であり；

各 u および v は、独立して0、1または2であり、ただし、u と v の合計は0、1または2であり；

各 p および q は、独立して0、1または2であり、ただし、p と q の合計は0、1または2であり、p が0の場合、q は1または2以外である）。

#### 【請求項2】

2 - [ ( 3 R , 4 S ) - 3 - [ [ ( 2 , 3 - ジフルオロフェニル ) アミノ ] カルボニル ] - 1 - メチル - 4 - [ 4 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] - 2 - ピロリジニリデン ] ヒドラジド2, 2 - ジメチルプロパン酸である、請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項3】

請求項1の化合物と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の成分とを含む、除草用組成物。

#### 【請求項4】

( a ) 請求項1の化合物と、( b ) ( b 1 ) 光学系I I 阻害剤、( b 2 ) アセトヒドロキシ酸シンターゼ ( A H A S ) 阻害剤、( b 3 ) アセチル - C o A カルボキシラーゼ ( A C C a s e ) 阻害剤、( b 4 ) オーキシシン模倣体、( b 5 ) 5 - エノール - ピルビルシキミ酸 - 3 - リン酸 ( E P S P ) シンターゼ阻害剤、( b 6 ) 光学系I 電子ダイパータ、( b 7 ) プロトボルフィリノーゲンオキシダーゼ ( P P O ) 阻害剤、( b 8 ) グルタミンシンセターゼ ( G S ) 阻害剤、( b 9 ) 超長鎖脂肪酸 ( V L C F A ) エロンガーゼ阻害剤、( b 1 0 ) オーキシシン輸送阻害剤、( b 1 1 ) フィトエンデサチュラーゼ ( P D S ) 阻害剤、( b 1 2 ) 4 - ヒドロキシフェニル - ピルビン酸ジオキシゲナーゼ ( H P P D ) 阻害剤、( b 1 3 ) ホモゲンチジン酸ソラネシルトランスフェラーゼ ( H S T ) 阻害剤、( b 1 4 ) セルロース生合成阻害剤、( b 1 5 ) 有糸分裂攪乱物質、有機ヒ素剤、アシュラム、プロモブチド、シンメシリン、クミルロン、ダゾメット、ジフェンゾコート、ダイムロン、エトベンザニド、フルレノール、ホサミン、ホサミン - アンモニウム、ヒダントシジン、メタム、メチルダイムロン、オレイン酸、オキサジクロメフォン、ペラルゴン酸およびピリブチカルブを含む他の除草剤、および( b 1 6 ) 除草剤薬害軽減剤；ならびに( b 1 ) ~ ( b 1 6 ) の化合物の塩から選択される少なくとも1種の追加の有効成分とを含む、除草用混合物。

#### 【請求項5】

望ましくない植生の成長を防除する方法であって、植生またはその環境に請求項1に記載の化合物の除草有効量を接触させることを含む、前記方法。

#### 【発明の詳細な説明】

#### 【技術分野】

#### 【0001】

本発明は、特定の除草用アミド、その( N - オキシド ) 塩および組成物、ならびに望ま

10

20

30

40

50

しくない植生の防除のためのそれらの使用方法に関する。

【背景技術】

【0002】

望ましくない植生の防除は、高い農作物生産効率を達成する上で極めて重要である。とりわけイネ、ダイズ、サトウダイコン、トウモロコシ、ジャガイモ、コムギ、オオムギ、トマト、およびプランテーション農作物のような有用な農作物において雑草の成長の選択的防除を達成することは、殊に望ましい。このような有用な農作物において雑草の成長を放置すると、生産性の大幅な低下をもたらす可能性があり、消費者へのコスト増加という結果を招く可能性がある。非農耕地における望ましくない植生の防除も同様に重要である。この目的のために多くの製品が市販されているが、より効果的で、より安価で、より毒性が低く、より環境に安全であり、または作用部位が異なる新しい化合物に対する必要性は、依然として存在する。特許文献1、特許文献2および特許文献3は、特定の除草用アミドを開示している。本発明の除草用アミドは、これらの公報には開示されていない。

10

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【文献】WO 2015 / 084796

WO 2016 / 003997

WO 2016 / 196593

【発明の概要】

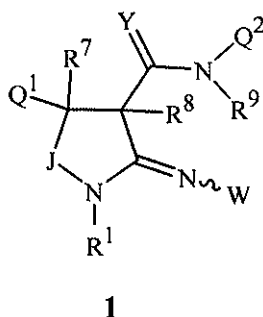
20

【課題を解決するための手段】

【0004】

本開示は、1つには、その全ての立体異性体およびN - オキシドを含む式1の化合物、ならびにそうした化合物、立体異性体およびN - オキシドの塩に関する：

【化1】



30

(式中、

Wは、-NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>または-OR<sup>C</sup>であり；

R<sup>A</sup>は、H、シアノ、CHO、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル；またはハロゲンもしくはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルで置換されているまたは非置換のフェニルであり；

40

R<sup>B</sup>は、H、シアノ、ヒドロキシ、CHO、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルコキシアルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>ハロアルコキシアルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキルチオアルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキルスルフィニルアルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキルスルホニルアルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>ハロアルキルカルボニル、C<sub>4</sub>~C<sub>10</sub>シクロアルキルカルボニル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>ハロアルコキシカルボニル、C<sub>4</sub>~C<sub>10</sub>シクロアルコキシカルボニル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>ジアルキルアミノカルボニル、C<sub>4</sub>~C<sub>10</sub>シクロアルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキルチオ、

50

C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキルスルフィニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルアミノスルホニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ジアルキルアミノスルホニルもしくは C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> トリアルキルシリルであり；または、フェニル環もしくはナフタレニル環系であり、各環もしくは環系は、R<sup>16</sup> から独立して選択される 5 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または、R<sup>16</sup> から独立して選択される 5 個以下の置換基で環員上で置換されているまたは非置換の 4 ~ 7 員複素環式環であり；または

R<sup>A</sup> および R<sup>B</sup> は、これらが両方とも結合している窒素原子と一緒にあって、炭素、酸素、窒素および - C ( = O ) - から選択される環員を含有する 4、5 もしくは 6 員環を形成しており；または、一緒にあって 6 ~ 10 員二環式環系となっており；または、一緒にあって 8 ~ 13 員三環式環系となっており、各環もしくは環系は、炭素、窒素および - C ( = O ) - から選択される環員を含有し、ハロゲン、シアノもしくは C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルで置換されているまたは非置換であり；

10

R<sup>C</sup> は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルカルボニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル；またはハロゲン、シアノもしくは C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルで置換されているまたは非置換のフェニル；またはハロゲン、シアノもしくは C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルで置換されているまたは非置換の 6 員窒素含有芳香族環であり；

J は、- CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup> -、- CR<sup>2</sup>R<sup>3</sup> - CR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> -、- NR<sup>6</sup> - または - O - ( 即ち、ここで、左に突出している結合手は NR<sup>1</sup> に結合している ) であり；

20

Y は、O、S または NR<sup>15</sup> であり；

R<sup>1</sup> は、H、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、CHO、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルカルボニルアルキル、- C ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル ) = N - O ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル )、- C ( O ) NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> シアノアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルケニル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシアルコキシアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロアルコキシアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロアルケニルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルチオアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルフィニルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロアルキルカルボニル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルキルカルボニル、C<sub>5</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルキルカルボニルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロアルコキシカルボニル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノカルボニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ジアルキルアミノカルボニル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキルチオ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキルスルフィニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルアミノスルホニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ジアルキルアミノスルホニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> トリアルキルシリルであり；または - CPh = N - O ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル ) であり、ここで、フェニルは、R<sup>13</sup> から独立して選択される 5 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または G<sup>1</sup> であり；

30

40

Q<sup>1</sup> は、フェニル環もしくはナフタレニル環系であり、各環もしくは環系は、R<sup>10</sup> から独立して選択される 5 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または、4 ~ 7 員複素環式環；もしくは 8 ~ 10 員二環式環系であり、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに 2 個以下の O 原子、2 個以下の S 原子および 5 個以下の N 原子から独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、3 個以下の炭素環員は C ( = O ) および C ( = S ) から独立して選択され、硫黄原子環員は S ( = O )<sub>u</sub> ( = NR<sup>14</sup> )<sub>v</sub> から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で R<sup>10</sup> から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で R<sup>12</sup> から独立して選択される 5 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；

50

$Q^2$  は、フェニル環もしくはナフタレニル環系であり、各環もしくは環系は、 $R^{11}$  から独立して選択される 5 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または、4 ~ 7 員複素環式環；もしくは 8 ~ 10 員二環式環系であり、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに 2 個以下の O 原子、2 個以下の S 原子および 5 個以下の N 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、3 個以下の炭素環員は  $C(=O)$  および  $C(=S)$  から独立して選択され、硫黄原子環員は  $S(=O)_u$  ( $=NR^{14}$ )<sub>v</sub> から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で  $R^{11}$  から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で  $R^{13}$  から独立して選択される 5 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；

$R^2$  および  $R^3$  は、それぞれ独立して H、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルもしくは  $C_1 \sim C_4$  アルコキシであり；または

$R^2$  および  $R^3$  は、これらが結合している炭素原子と一緒になって  $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル環を形成しており；

$R^4$  および  $R^5$  は、それぞれ独立して H、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルまたは  $C_1 \sim C_4$  アルコキシであり；

$R^6$  は、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_3 \sim C_6$  アルキニルもしくは  $C_1 \sim C_6$  アルコキシであり；または

$R^1$  および  $R^6$  は、一緒になって  $C_3 \sim C_6$  アルキレンもしくは  $-CH_2OCH_2-$  となっており；

$R^7$  および  $R^8$  は、それぞれ独立して H、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルまたは  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり；

$R^9$  は、H、ヒドロキシ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_3 \sim C_6$  アルキニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$  ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$  ジアルキルアミノスルホニルもしくは  $C_3 \sim C_{10}$  トリアルキルシリル；または  $G^1$  であり；

各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立してハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_1 \sim C_8$  シアノアルキル、 $C_1 \sim C_8$  シアノアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_8$  ヒドロキシアルキル、 $C_1 \sim C_8$  ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$  ニトロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$  アルキニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$  アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、シクロプロピルメチル、1 - メチルシクロプロピル、2 - メチルシクロプロピル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$  ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$  アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$  シクロアルキルアルケニル、 $C_5 \sim C_{12}$  シクロアルキルアルキニル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$  アルキルシクロアルキル、 $C_6 \sim C_{12}$  シクロアルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$  ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$  アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$  ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim$

10

20

30

40

50



C<sub>8</sub> ハロジアルキルアミノ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロアルキルアミノアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルキルアミノアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ジアルキルアミノアルキル、-CHO、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロアルキルカルボニル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルキルカルボニル、-C(=O)OH、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロアルコキシカルボニル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルコキシカルボニル、C<sub>5</sub> ~ C<sub>12</sub> シクロアルキルアルコキシカルボニル、-C(=O)NH<sub>2</sub>、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノカルボニル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルキルアミノカルボニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ジアルキルアミノカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロアルコキシ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコシアルコキシ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルオキシ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロアルケニルオキシ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルオキシ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロアルキニルオキシ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルコキシ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロシクロアルコキシ、C<sub>4</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルキルアルコキシ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> アルキルカルボニルアルコキシ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルカルボニルオキシ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロアルキルカルボニルオキシ、C<sub>4</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルキルカルボニルオキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニルオキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロアルキルスルホニルオキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロアルキルチオ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロアルキルスルホニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキルスルホニル、ホルミルアミノ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルカルボニルアミノ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロアルキルカルボニルアミノ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキルアミノ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシカルボニルアミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルスルホニルアミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキルスルホニルアミノ、-SF<sub>5</sub>、-SCN、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C<sub>3</sub> ~ C<sub>12</sub> トリアルキルシリル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>12</sub> トリアルキルシリルアルキルもしくはC<sub>4</sub> ~ C<sub>12</sub> トリアルキルシリルアルコキシであり；またはG<sup>2</sup>であり；または、R<sup>20</sup>S(=O)=N-、R<sup>20</sup>S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>19</sup>-C(=O)-もしくはR<sup>20</sup>(R<sup>19</sup>N=)<sub>q</sub>S(=O)<sub>p</sub>-であり、ここで、右に突出している自由結合手はQ<sup>1</sup>への結合点を示し；

10

20

各R<sup>12</sup>およびR<sup>13</sup>は、独立してシアノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ヒドロキシアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコキシ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルアミノアルキルまたはC<sub>3</sub> ~ C<sub>4</sub> ジアルキルアミノアルキルであり；

30

各R<sup>14</sup>は、独立してH、シアノ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルカルボニルまたはC<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> ハロアルキルカルボニルであり；

R<sup>15</sup>は、H、シアノ、ヒドロキシ、CHO、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルコキシ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルカルボニルまたはC<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキルカルボニルであり；

各G<sup>1</sup>は、独立してフェニルであり；または5もしくは6員複素環式環であり、それぞれ、R<sup>17</sup>から独立して選択される5個以下の置換基で環員上で置換されているまたは非置換であり；

各G<sup>2</sup>は、独立してフェニル、フェニルメチル（即ち、ベンジル）、ピリジニルメチル、フェニルカルボニル（即ち、ベンゾイル）、フェノキシ、フェニルエチニル、フェニルスルホニル、または5もしくは6員複素環式環であり、それぞれ、R<sup>18</sup>から独立して選択される5個以下の置換基で環員上で置換されているまたは非置換であり；

40

各R<sup>16</sup>、R<sup>17</sup>およびR<sup>18</sup>は、独立してハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、-CHO、-C(=O)OH、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ヒドロシアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロアルキルカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコシアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルアミノアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルコキシカルボニル、C<sub>5</sub> ~ C<sub>12</sub> シクロアルキルアルコキシカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノカルボニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ジアルキルアミノカルボニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> ジアルキルアミノアルキル、

50

C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルコキシ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルカルボニルオキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルアミノスルホニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ジアルキルアミノスルホニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> トリアルキルシリル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルアミノ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ジアルキルアミノ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルカルボニルアミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルスルホニルアミノ、フェニル、ピリジニルまたはチエニルであり；

各 R<sup>19</sup> は、独立して H、シアノ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルカルボニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> ハロアルキルカルボニルであり；

各 R<sup>20</sup> は、独立して H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ハロアルコキシアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルチオアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルフィニルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニルアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> トリアルキルシリルまたは G<sup>1</sup> であり；

各 u および v は、独立して 0、1 または 2（即ち、S(=O)<sub>u</sub>(=NR<sup>14</sup>)<sub>v</sub> の各事例において）であり、ただし、u と v の合計は 0、1 または 2 であり；

各 p および q は、独立して 0、1 または 2（即ち、R<sup>20</sup>(R<sup>19</sup>N=)<sub>q</sub>S(=O)<sub>p</sub> の各事例において）であり、ただし、p と q の合計は 0、1 または 2 であり、p が 0 の場合、q は 1 または 2 以外である）。

#### 【0005】

より詳細には、本発明は、式 1 の化合物（全ての立体異性体を含む）、その N - オキシドまたは塩に関する。本発明は更に、本発明の化合物（即ち、除草有効量の）と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の成分を含む除草用組成物に関する。本発明は更に、植生またはその環境に本発明の化合物（例えば、本明細書に記載する組成物としての）の除草有効量を接触させることを含む、望ましくない植生の成長を防除する方法に関する。

#### 【0006】

本発明は更に、以下に記載するように、(a) 式 1 から選択される化合物、その N - オキシドおよび塩と、(b) (b1) ~ (b16) から選択される少なくとも 1 種の追加の有効成分；および (b1) ~ (b16) の化合物の塩を含む除草用混合物を含む。

#### 【発明を実施するための形態】

#### 【0007】

本明細書において使用する場合、「含む (comprises)」、「含む (comprising)」、「含む (includes)」、「含む (including)」、「有する (has)」、「有する (having)」、「含有する (contains)」、「含有する (containing)」、「特徴とする (characterized by)」という用語またはそれらの任意の他の変形は、明示的に示された制限に従って非排他的包摂を包含することを意図している。例えば、列挙した要素を含む組成物、混合物、プロセスまたは方法は、必ずしもそれらの要素に限定されるものではなく、明確に列挙されていない他の要素、またはそうした組成物、混合物、プロセスまたは方法に特有な他の要素を含んでもよい。

#### 【0008】

「からなる (consisting of)」という移行句は、指定されていない要素、工程、または原材料を除外する。請求項の中にある場合、そうした移行句は、請求項が、通常それに付随する不純物を除く、記載されたもの以外の材料を包含しないことを意味する。「からなる」という句が、プリアンブルの直後ではなく、請求項の本文の分節に出てきた場合、その分節に記載された要素のみを限定し、他の要素は、全体としてその請求項から除外されない。

#### 【0009】

10

20

30

40

50

「本質的に～からなる (consisting essentially of)」という移行句は、文字通り開示されたものに追加の材料、工程、特徴物、成分、または要素を含む組成物または方法を定義するために使用される。ただし、これら追加の材料、工程、特徴物、成分、または要素は、特許請求される発明の基本的な特性および新規な特性に実質的に影響を及ぼさない。「本質的に～からなる」という用語は、「含む (comprising)」と「からなる (consisting of)」の中間の地位を占める。

【0010】

出願人が、発明またはその一部を「含む」のようなオープンエンドの用語を用いて定義していた場合、記載が（別段の記載がない限り）、そうした発明を「本質的に～からなる」または「からなる」という用語を使用して説明しているとも解釈すべきであることは、

10

【0011】

更に、反対のことが明示的に述べられていない限り、「または」は、排他的「または」ではなく包括的「または」を意味する。例えば、条件 A または B は、以下のいずれかによって満たされる：A が真であり（または存在する）B が偽である（または存在しない）、A が偽であり（または存在しない）B が真である（または存在する）、および A と B がどちらも真である（または存在する）。

【0012】

また、本発明の要素または成分に先行する不定冠詞「a」および「an」は、その要素または成分の事例（即ち、発生）の数に関して非制限的であることを意図している。したがって、「a」または「an」は、1 つまたは少なくとも 1 つを含むものとして読み取るべきであり、要素または成分の単語の単数形は、その数が明らかに単数を意図していない限り、複数も含む。

20

【0013】

本明細書において言及している場合、単独で、または「広葉雑草」のような言葉の中で使用される「広葉」という用語は、2 枚の子葉を持つ胚を特徴とする被子植物の群を説明するために使用される用語である双子葉植物または双子葉類を意味する。

【0014】

本明細書において使用する場合、「アルキル化剤」という用語は、炭素含有ラジカルが炭素原子を介してハライドまたはスルホナートのような脱離基に結合し、求核試薬の前記炭素原子への結合によって置き換え可能な化合物を指す。別段の指示がない限り、「アルキル化」という用語は、炭素含有ラジカルをアルキルに限定しない。

30

【0015】

上記の記述において、単独で、または「アルキルチオ」もしくは「ハロアルキル」のような複合語において使用される「アルキル」という用語は、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、または異なるブチル、ペンチルもしくはヘキシル異性体のような、直鎖または分枝アルキルを含む。「アルケニル」は、エテニル、1 - プロペニル、2 - プロペニル、ならびに異なるブテニル、ペンテニルおよびヘキセニル異性体のような、直鎖または分枝アルケンを含む。「アルケニル」は、1, 2 - プロパジエニルおよび 2, 4 - ヘキサジエニルのようなポリエンを更に含む。「アルキニル」は、エチニル、1 - プロピニル、2 - プロピニル、ならびに異なるブチニル、ペンチニルおよびヘキシニル異性体のような、直鎖または分枝アルキンを含む。「アルキニル」は、2, 5 - ヘキサジイニルのような複数の三重結合で構成される部分を更に含むことができる。「アルキレン」は、直鎖または分枝アルカンジイルを表す。「アルキレン」の例としては、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$  および異なるブチレン、ペンチレン、およびヘキシレン異性体が挙げられる。「アルケニレン」は、1 つのオレフィン結合を含有する直鎖または分枝アルケンジイルを表す。

40

【0016】

「アルコキシ」は、例えば、メトキシ、エトキシ、n - プロピルオキシ、イソプロピルオキシ、ならびに異なるブトキシ、ペントキシおよびヘキシルオキシ異性体を含む。「ア

50

ルコキシアルキル」は、アルキル上でのアルコキシ置換を表す。「アルコキシアルキル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$  および  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$  が挙げられる。「アルコキシアルコキシアルキル」は、少なくともアルコキシアルキル部分のアルコキシ部分上でのアルコキシ置換を表す。「アルコキシアルコキシアルキル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{OCH}_2$  -、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_3)\text{CHOCH}_2$  - および  $(\text{CH}_3\text{O})_2\text{CHOCH}_2$  - が挙げられる。「アルコキシアルコキシ」は、アルコキシ上でのアルコキシ置換を表す。アルコキシアルコキシの例としては、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 、および  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}$  が挙げられる。「アルケニルオキシ」は、直鎖または分枝アルケニルオキシ部分を含む。「アルケニルオキシ」の例としては、 $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}$  および  $\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$  が挙げられる。「アルキニルオキシ」は、直鎖または分枝アルキニルオキシ部分を含む。「アルキニルオキシ」の例としては、 $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ 、 $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$  および  $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$  が挙げられる。「アルキルチオ」は、メチルチオ、エチルチオ、ならびに異なるプロピルチオ、ブチルチオ、ペンチルチオおよびヘキシルチオ異性体のような、分枝または直鎖アルキルチオ部分を含む。「アルキルスルフィニル」は、アルキルスルフィニル基の両方のエナンチオマーを含む。「アルキルスルフィニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})$  -、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$  -、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$  -、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})$  -、ならびに異なるブチルスルフィニル、ペンチルスルフィニルおよびヘキシルスルフィニル異性体が挙げられる。「アルキルスルホニル」は、直鎖または分枝アルキル基で置換されたスルホニル部分を表す。「アルキルスルホニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2$  -、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$  -、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$  -、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2$  -、ならびに異なるブチルスルホニル、ペンチルスルホニルおよびヘキシルスルホニル異性体が挙げられる。「アルキルチオアルキル」は、アルキル上でのアルキルチオ置換を表す。「アルキルチオアルキル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$  および  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$  が挙げられる。「アルキルスルフィニルアルキル」は、アルキル上でのアルキルスルフィニル置換を表す。「アルキルスルフィニルアルキル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2$  および  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2$  が挙げられる。「アルキルスルホニルアルキル」は、アルキル上でのアルキルスルホニル置換を表す。「アルキルスルホニルアルキル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2$  および  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_2$  が挙げられる。「アルキルスルホニルオキシ」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2\text{O}$  -、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}$  - および  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}$  - が挙げられる。「アルキルアミノ」、「ジアルキルアミノ」、「ハロジアルキルアミノ」などは、上記の例と同様に定義される。「アルキルスルホニルアミノ」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})\text{NH}$  - および  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})\text{NH}$  - が挙げられる。「アルキルアミノアルキル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{NHCH}_2$  -、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHCH}_2$  - および  $\text{CH}_3\text{NHCH}(\text{CH}_3)$  - が挙げられる。「ジアルキルアミノアルキル」の例としては、 $(\text{CH}_3)_2\text{NCH}_2$  -、 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(\text{CH}_3)\text{H}$  - および  $(\text{CH}_3)(\text{CH}_3)\text{NCH}_2$  - が挙げられる。「アルキルアミノカルボニル」の例としては、 $(\text{CH}_3)\text{NHC}(\text{O})$  - および  $(\text{CH}_3\text{CH}_2)\text{NHC}(\text{O})$  - が挙げられる。「ジアルキルアミノカルボニル」の例は、 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(\text{O})$  - である。「アルキルアミノスルホニル」の例は、 $(\text{CH}_3)\text{NHS}(\text{O})_2$  - であり、「ジアルキルアミノスルホニル」の例は、 $(\text{CH}_3)_2\text{NS}(\text{O})_2$  - である。「アルキルカルボニルアミノ」という用語は、カルボニルアミノ基の  $\text{C}(=\text{O})$  部分に結合した直鎖または分枝アルキル部分を表す。「アルキルカルボニルアミノ」の例としては、 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})\text{NH}$  - および  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NH}$  - が挙げられる。「アルコシカルボニルアミノ」という用語は、カルボニルアミノ基の  $\text{C}(=\text{O})$  部分に結合した直鎖または分枝アルコキシ部分を表

10

20

30

40

50

す。「アルコキシカルボニルアミノ」の例としては、 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})\text{NH}-$  および  $\text{H}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{NH}-$  が挙げられる。

#### 【0017】

「シクロアルキル」は、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルを含む。「アルキルシクロアルキル」という用語は、シクロアルキル部分上でのアルキル置換を表し、例えば、エチルシクロプロピル、*i*-プロピルシクロブチル、3-メチルシクロペンチルおよび4-メチルシクロヘキシルを含む。「シクロアルキルアルキル」という用語は、アルキル部分上でのシクロアルキル置換を表す。「シクロアルキルアルキル」の例としては、シクロプロピルメチル、シクロペンチルエチル、および直鎖または分枝アルキル基に結合した他のシクロアルキル部分が挙げられる。「アルキルシクロアルキルアルキル」という用語の例としては、1-メチルシクロプロピルメチルおよび2-メチルシクロペンチルエチルが挙げられる。「シクロアルキルアルケニル」という用語は、アルケニル部分に結合したシクロアルキルを表す。「シクロアルキルシクロアルキル」という用語は、単結合によるシクロアルキル部分上でのシクロアルキル置換を表す。「シクロアルキルアルキニル」という用語は、アルキニル部分に結合したシクロアルキルを表す。「シクロアルキルアミノ」という用語は、アミノ部分に結合したシクロアルキルを表す。「シクロアルキルアミノカルボニル」という用語は、アミノカルボニル部分に結合したシクロアルキルを表す。「シクロアルキルアミノアルキル」という用語は、アミノアルキル部分に結合したシクロアルキルを表す。「シクロアルキルカルボニル」という用語は、カルボニル部分に結合したシクロアルキルを表す。「シクロアルキルカルボニルアルキル」という用語は、カルボニルアルキル部分に結合したシクロアルキルを表す。「シクロアルキルカルボニルオキシ」という用語は、カルボニルオキシ部分の炭素原子に結合したシクロアルキルを表す。「シクロアルコキシ」という用語は、シクロペンチルオキシおよびシクロヘキシルオキシのような、酸素原子を介して結合したシクロアルキルを表す。「シクロアルコキシアルキル」という用語は、アルキル部分を介して結合したシクロアルコキシを表す。「シクロアルキルチオ」、「シクロアルキルスルフィニル」および「シクロアルキルスルホニル」という用語は、それぞれ硫黄、スルフィニルまたはスルホニル部分を介して結合したシクロアルキルを表す。

#### 【0018】

「シクロアルコキシカルボニル」という用語は、カルボニル部分を介して結合したシクロアルコキシを表す。「シクロアルキルアルコキシ」は、アルキル鎖に結合した酸素原子を介して結合したシクロアルキルアルキルを表す。「シクロアルキルアルコキシ」の例としては、シクロプロピルメトキシ、シクロペンチルエトキシ、および直鎖または分枝アルコキシ基に結合した他のシクロアルキル部分が挙げられる。「シクロアルケニル」は、シクロペンテニルおよびシクロヘキセニルのような基に加えて、1, 3- および 1, 4- シクロヘキサジエニルのような2つ以上の二重結合を有する基を含む。「ハロシクロアルケニル」という用語は、シクロアルケニル部分上でのハロゲン置換を表す。

#### 【0019】

「ハロゲン」という用語は、単独で、もしくは「ハロアルキル」のような複合語において、または「ハロゲンで置換されているアルキル」のような記載において使用される場合、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を含む。更に、「ハロアルキル」のような複合語において使用される場合、または「ハロゲンで置換されているアルキル」のような記載において使用される場合、前記アルキルは、同一であっても異なってもよいハロゲン原子で部分的にまたは完全に置換されていてもよい。「ハロアルキル」または「ハロゲンで置換されているアルキル」の例としては、 $\text{F}_3\text{C}$ 、 $\text{ClCH}_2$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2$  および  $\text{CF}_3\text{CCl}_2$  が挙げられる。「ハロシクロアルキル」、「ハロシクロアルキルアルキル」、「ハロシクロアルコキシ」、「ハロアルコキシ」、「ハロアルコキシアルコキシ」、「ハロアルキルチオ」、「ハロアルキルスルフィニル」、「ハロアルキルスルホニル」、「ハロアルケニル」、「ハロアルキニル」、「ハロアルケニルオキシ」、「ハロアルケニルアルキル」、「ハロアルキルカルボニル」、「ハロアルキルカルボニルアミノ」、「ハロアルキル

スルホニルアミノ」、「ハロアルコキシハロアルコキシ」、「ハロアルキルスルホニルオキシ」、「ハロアルキニルオキシ」、「ハロアルコキシアルキル」、「ハロアルキルカルボニルオキシ」、「ハロアルキルアミノアルキル」などの用語は、「ハロアルキル」という用語と同様に定義される。「ハロアルコキシ」の例としては、 $\text{CF}_3\text{O}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$  および  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}-$  が挙げられる。「ハロアルキルチオ」の例としては、 $\text{CCl}_3\text{S}-$ 、 $\text{CF}_3\text{S}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}-$  および  $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$  が挙げられる。「ハロアルキルスルフィニル」の例としては、 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$  および  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})-$  が挙げられる。「ハロアルキルスルホニル」の例としては、 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$  および  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2-$  が挙げられる。「ハロアルキルスルホニルオキシ」の例としては、 $\text{CHCl}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ 、 $\text{CH}_2\text{ClCH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$  および  $\text{CH}_3\text{CHClCH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$  が挙げられる。「ハロアルケニル」の例としては、 $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2-$  および  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$  が挙げられる。「ハロアルケニルオキシ」の例としては、 $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}-$  および  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}-$  が挙げられる。「ハロアルキニル」の例としては、 $\text{HC}-\text{CCHCl}-$ 、 $\text{CF}_3\text{C}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{C}-$  および  $\text{FCH}_2\text{C}-\text{CH}_2-$  が挙げられる。「ハロアルキニルオキシ」の例としては、 $\text{HC}-\text{CCHClO}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{C}-$  および  $\text{FCH}_2\text{C}-\text{CH}_2\text{O}-$  が挙げられる。「ハロアルコキシアルキル」の例としては、 $\text{CF}_3\text{OCH}_2-$ 、 $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ 、 $\text{Cl}_3\text{CCH}_2\text{OCH}_2-$  に加えて、分枝アルキル誘導体が挙げられる。「ハロアルコキシカルボニル」の例としては、 $\text{CF}_3\text{OC}(\text{O})-$ 、 $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ 、 $\text{Cl}_3\text{CCH}_2\text{OCH}_2\text{OC}(\text{O})-$  に加えて、分枝アルキル誘導体が挙げられる。

#### 【0020】

「アルキルカルボニル」は、 $\text{C}(=\text{O})$  部分に結合した直鎖または分枝アルキル部分を表す。「アルコキシカルボニル」は、 $\text{C}(=\text{O})$  部分に結合した直鎖または分枝アルコキシ部分を表す。「アルキルカルボニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$  および  $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})-$  が挙げられる。「アルコキシカルボニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})-$  および異なるブトキシまたはペンタオキシカルボニル異性体が挙げられる。「シクロアルキルアルコキシカルボニル」は、アルコキシカルボニル部分の酸素原子に結合したシクロアルキルアルキル部分を表す。「シクロアルキルアルコキシカルボニル」の例としては、シクロプロピル- $\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ 、シクロプロピル- $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{OC}(=\text{O})-$  およびシクロペンチル- $\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$  が挙げられる。「アルキルカルボニルアルキル」は、カルボニルアルキル部分の炭素原子に結合した直鎖または分枝鎖アルキル基を表す。「アルキルカルボニルアルキル」の例としては、 $(\text{CH}_3)\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$  および  $(\text{CH}_3\text{CH}_2)\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$  が挙げられる。「アルキルカルボニルオキシ」は、カルボニルオキシ部分の炭素原子に結合した直鎖または分枝鎖アルキル基を表す。「アルキルカルボニルオキシ」の例としては、 $(\text{CH}_3)\text{C}(=\text{O})\text{O}-$  および  $(\text{CH}_3\text{CH}_2)\text{C}(=\text{O})\text{O}-$  が挙げられる。

#### 【0021】

「シアノアルキル」または「シアノアルコキシ」という用語は、それぞれアルキルまたはアルコキシ部分を介して結合したシアノ基を意味する。シアノ基中の炭素は、この用語についての炭素原子の総数に含まれない。「ニトロアルキル」または「ニトロアルケニル」という用語は、それぞれアルキルまたはアルケニル部分を介して結合したニトロ基を表す。「ヒドロキシアルキル」という用語は、アルキル部分を介して結合したヒドロキシル基を意味する。「トリアルキルシリル」という用語は、ケイ素を介して結合した3つのアルキル基を意味する。「トリアルキルシリルアルキル」という用語は、シリルアルキル部分を介して結合した3つのアルキル基を意味する。「トリアルキルシリルアルコキシ」という用語は、シリルアルコキシ部分を介して結合した3つのアルキル基を意味する。

## 【 0 0 2 2 】

置換基中の炭素原子の総数は、「 $C_i \sim C_j$ 」という接頭辞によって表され、ここで、 $i$  および  $j$  は、1 ~ 12 の数である。例えば、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルホニルは、メチルスルホニルからブチルスルホニルを指定し； $C_2$  アルコキシアルキルは、 $CH_3OCH_2-$  を指定し； $C_3$  アルコキシアルキルは、例えば、 $CH_3CH(OCH_3)-$ 、 $CH_3OCH_2CH_2-$  または  $CH_3CH_2OCH_2-$  を指定し； $C_4$  アルコキシアルキルは、全部で4個の炭素原子を含有するアルコキシ基で置換されたアルキル基の様々な異性体を指定し、その例としては、 $CH_3CH_2CH_2OCH_2-$  および  $CH_3CH_2OCH_2CH_2-$  が挙げられる。

## 【 0 0 2 3 】

置換基の数が1を超えることがあることを示す下付き文字を伴う置換基で化合物が置換されている場合、前記置換基は（1を超える場合）、定義された置換基の群、例えば、 $(R^7)_n$ 、 $n$  は1、2、3、4または5である）から独立して選択される。基が、水素とすることができる置換基、例えば  $R^2$  または  $R^3$  を含有する場合、この置換基が水素とされる場合には、これは、前記基が未置換であることと等しいと認識される。可変基が場合によりある位置に結合していると示されている場合、例えば  $R^{(7)}_n$  の  $n$  が0であり得る場合、可変基の定義に記載されていなくても、水素がその位置にあってもよい。ある基上の1つまたはそれ以上の位置が「置換されていない」または「非置換」と記載される場合、水素原子が結合して任意の自由原子価を取る。

## 【 0 0 2 4 】

原子の環に関する「完全飽和」という表現は、環の原子間の結合が全て単結合であることを意味する。環に関する「完全不飽和」という表現は、環中の原子間の結合が、原子価結合理論に従って単結合または二重結合であり、更に、環中の原子間の結合が、二重結合が累積的であることなく（即ち、 $C=C=C$ 、 $N=C=C$  などを含まず）、可能な限り多くの二重結合を含むことを意味する。環に関する「部分不飽和」という用語は、隣接する環員に二重結合を介して結合した少なくとも1つの環員を含み、概念的には、存在する二重結合（即ち、その部分不飽和形態での）の数よりも多くの非累積二重結合（即ち、その完全不飽和相当形態での）を隣接する環員を介して潜在的に収容する環を表す。完全不飽和環がヒュッケルの法則を満たす場合、これは、芳香族と記載することもできる。

## 【 0 0 2 5 】

別段の指示がない限り、式1の成分としての「環」または「環系」（例えば、置換基  $Q^1$ ）は、炭素環式または複素環式である。「環系」という用語は、2つ以上の縮合した環を表す。「二環式環系」および「縮合二環式環系」という用語は、2つの縮合した環からなる環系を表し、別段の指示がない限り、いずれの環も飽和、部分不飽和、または完全不飽和であり得る。「縮合複素二環式環系」という用語は、少なくとも1つの環原子が炭素ではない縮合した二環式環系を表す。「環員」という用語は、環または環系の骨格を形成している原子または他の部分（例えば、 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(=O)$  または  $S(=O)_2$ ）を指す。

## 【 0 0 2 6 】

「炭素環式環」、「炭素環」または「炭素環式環系」という用語は、環骨格を形成している原子が炭素のみから選択される環または環系を表す。別段の指示がない限り、炭素環式環は、飽和、部分不飽和、または完全不飽和の環であり得る。完全不飽和の炭素環式環がヒュッケル則を満たす場合、前記環は、「芳香族環」とも呼ばれる。「飽和炭素環式」は、互いに単結合で結合した炭素原子からなる骨格を有する環を指し；特別の定めがない限り、残りの炭素の原子価は、水素原子によって占められる。

## 【 0 0 2 7 】

「複素環式環」、「複素環」または「複素環式環系」という用語は、環骨格を形成している少なくとも1個の原子が炭素ではなく、例えば、窒素、酸素または硫黄である環または環系を表す。典型的には、複素環式環は、5個以下の窒素、2個以下の酸素、および2個以下の硫黄を含有する。別段の指示がない限り、複素環式環は、飽和、部分不飽和、ま

10

20

30

40

50

たは完全不飽和の環であり得る。完全不飽和の複素環式環がヒュッケル則を満たす場合、前記環は、「複素芳香族環」または「芳香族複素環式環」とも呼ばれる。別段の指示がない限り、複素環式環および環系は、任意の利用可能な炭素または窒素を介し、前記炭素または窒素上の水素の置換によって結合することが可能である。

#### 【0028】

「芳香族」は、環原子のそれぞれが本質的に同一平面上にあり、環平面に垂直な p 軌道を有すること、および  $(4n + 2)$  個 ( $n$  は正の整数) の電子が環と関連してヒュッケル則に従うことを指す。「芳香族環または環系」という用語は、環または環系の少なくとも 1 つの環が芳香族である炭素環式または複素環式環または環系を表す。「芳香族環または環系」という用語は、「アリアル」とも呼ばれる。「芳香族炭素環式環系」という用語は、環系の少なくとも 1 つの環が芳香族である炭素環式環系を表す。「芳香族複素環式環系」という用語は、環系の少なくとも 1 つの環が芳香族である複素環式環系を表す。「非芳香族環系」という用語は、完全飽和だけでなく、部分的にまたは完全に不飽和であり得るが、ただし、環系内のどの環も芳香族ではない炭素環式または複素環式環系を表す。「非芳香族炭素環式環系」という用語は、環系中の環がいずれも芳香族ではない炭素環式環系を記載する。「非芳香族複素環式環系」という用語は、環系内の環がいずれも芳香族ではない複素環式環系を表す。

10

#### 【0029】

複素環式環に関する「置換されているまたは非置換の」または「場合により置換されている」という用語は、非置換であるか、または非置換の類似体が有する生物学的活性を消失させない少なくとも 1 つの非水素置換基を有する基を意味する。本明細書において使用する場合、別段の指示がない限り以下の定義が適用される。「置換されているまたは非置換の」という用語は、「場合により置換されている」という句、または「(非)置換」という用語と交換可能に使用される。別段の指示がない限り、場合により置換されている基は、基の置換可能な位置それぞれに置換基を有していてもよく、各置換は他の置換から独立している。

20

#### 【0030】

$Q^1$  または  $Q^2$  が 4 ~ 7 員複素環式環系である場合、他様の記載がない限り、任意の利用可能な炭素または窒素環原子を介して式 1 の残部に結合していてもよい。上記のように、 $Q^1$  および  $Q^2$  は、(とりわけ) 発明の概要において定義した置換基の群から選択される 1 つまたはそれ以上の置換基で場合により置換されているフェニルとすることができる。場合により 1 ~ 5 個の置換基で置換されているフェニルの例は、提示 1 に U - 1 として図示する環であり、ここで、例えば、 $R^v$  は、発明の概要において  $Q^1$  について定義したように  $R^{10}$  であり、または  $R^v$  は、発明の概要において  $Q^2$  について定義したように  $R^1$  であり、 $r$  は整数 (0 ~ 5) である。

30

#### 【0031】

上記のように、 $Q^1$  および  $Q^2$  は、(とりわけ) 発明の概要において定義した置換基の群から選択される 1 つまたはそれ以上の置換基で置換されているまたは非置換の 5 または 6 員不飽和複素環式環とすることができる。1 つまたはそれ以上の置換基で置換されているまたは非置換の 5 または 6 員不飽和芳香族複素環式環の例としては、提示 1 に図示する環 U - 2 ~ U - 61 が挙げられ、ここで、 $R^v$  は、 $Q^1$  および  $Q^2$  について発明の概要において定義した任意の置換基であり、 $r$  は 0 ~ 4 の整数であって、各 U 基上の利用可能な位置の数によって限定される。U - 29、U - 30、U - 36、U - 37、U - 38、U - 39、U - 40、U - 41、U - 42 および U - 43 は利用可能な位置が 1 つしかないため、これらの U 基については  $r$  は 0 または 1 の整数に限定され、 $r$  が 0 であるということは、U 基が非置換であって、 $(R^v)_r$  で示される位置に水素が存在することを意味する。

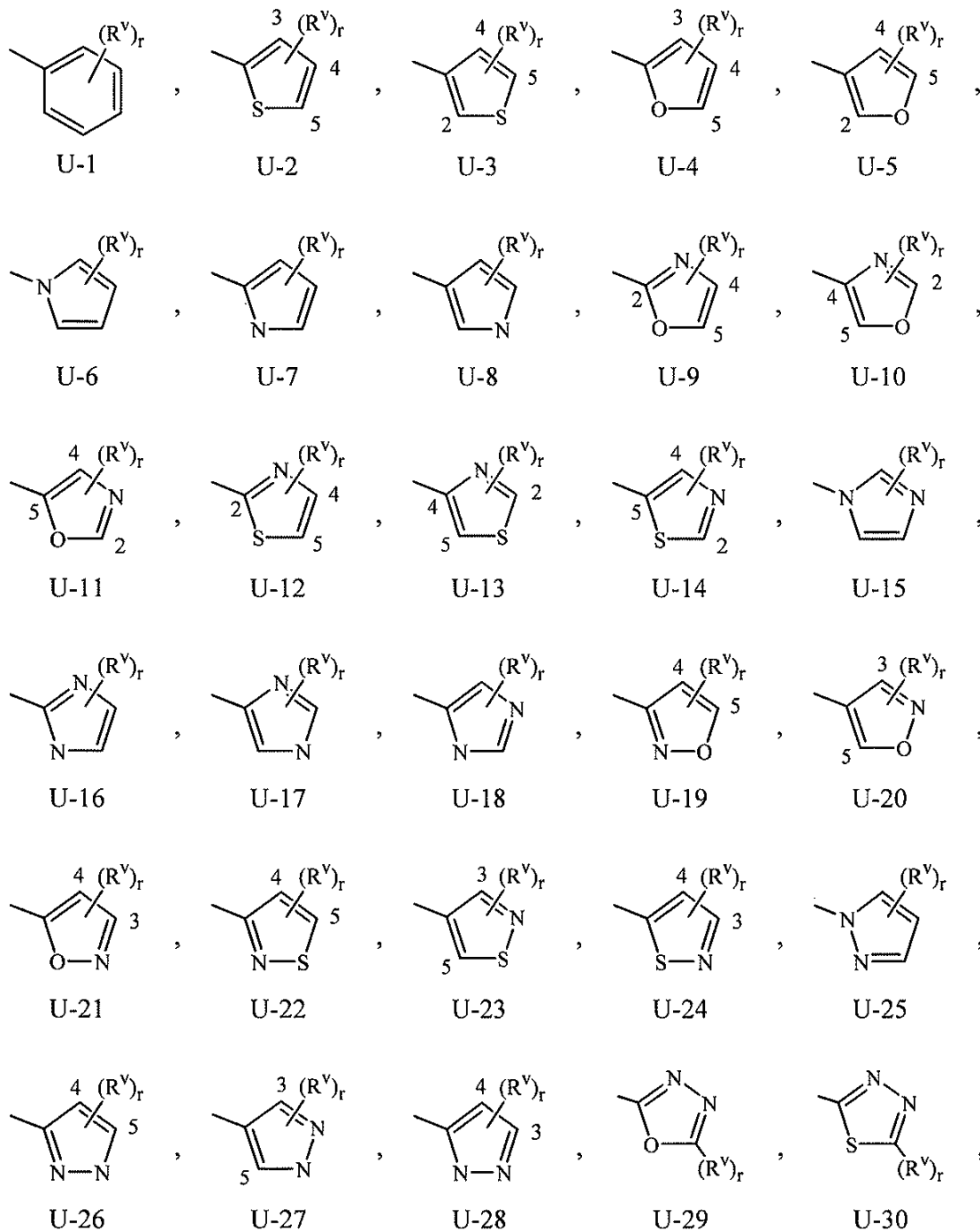
40

#### 【0032】



## 【化 2】

## 提示 1



10

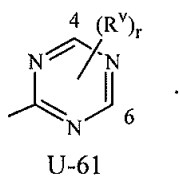
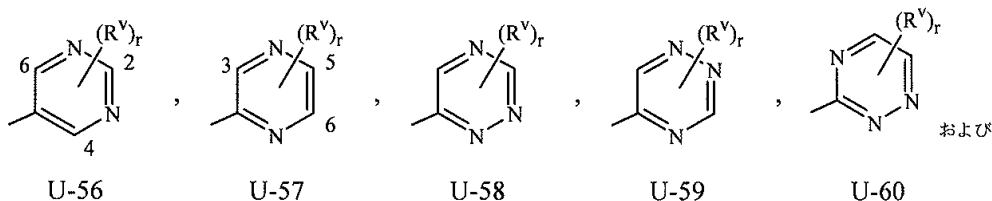
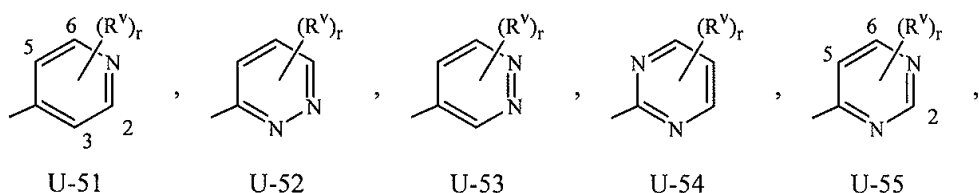
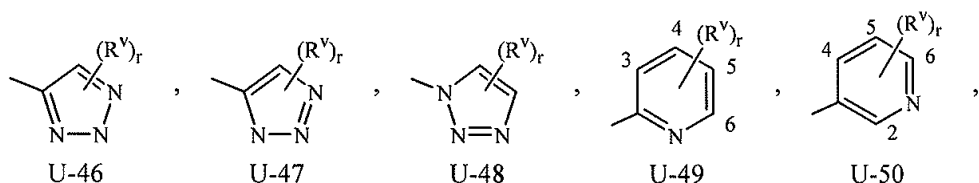
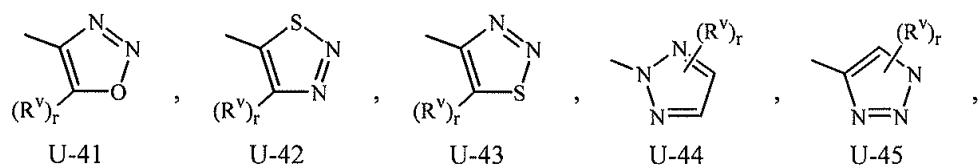
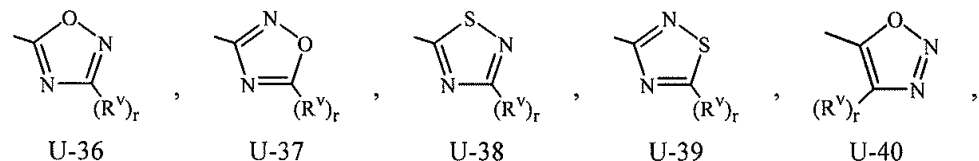
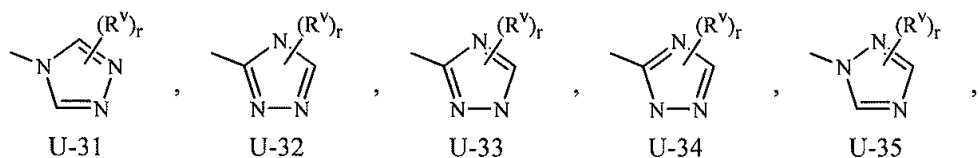
20

30

40

50

## 【化 3】



## 【 0 0 3 3 】

Q<sup>1</sup>またはQ<sup>2</sup>が、発明の概要においてQ<sup>1</sup>またはQ<sup>2</sup>について定義した置換基の群から選択される1つまたはそれ以上の置換基で場合により置換されている5または6員の飽和または不飽和非芳香族複素環式環である場合、複素環の1つまたは2つの炭素環員は、場合によりカルボニル部分の酸化形態であり得ることに留意されたい。

## 【 0 0 3 4 】

2個以下のO原子および2個以下のS原子から選択される環員を含有し、5個以下の炭素原子環員上で発明の概要において定義した置換基で場合により置換されている5または6員の飽和または非芳香族不飽和複素環式環の例としては、提示2に図示する環G - 1 ~

10

20

30

40

50

G - 3 5 が挙げられる。G 基上の結合点が浮遊しているものとして図示されている場合、G 基は、G 基の任意の利用可能な炭素または窒素を介し、水素原子の置換によって式 1 の残部に結合可能であることに留意されたい。R<sup>v</sup> に対応する任意選択の置換基は、水素原子の置換によって任意の利用可能な炭素または窒素に結合可能である。これらの G 環の場合、r は典型的には 0 ~ 4 の整数であり、各 G 基上の利用可能な位置の数によって限定される。

【 0 0 3 5 】

Q<sup>1</sup> または Q<sup>2</sup> が G - 2 8 ~ G - 3 5 から選択される環を含む場合、G<sup>2</sup> は、O、S または N から選択されることに留意されたい。G<sup>2</sup> が N である場合、窒素原子は、H または発明の概要において Q<sup>1</sup> または Q<sup>2</sup> について定義した R<sup>v</sup> に対応する置換基（即ち、炭素原子上の R<sup>1 0</sup> または R<sup>1 1</sup> および窒素原子上の R<sup>1 2</sup> または R<sup>1 3</sup>）のいずれかでの置換によってその原子価を満たすことができることに留意されたい。

【 0 0 3 6 】

10

20

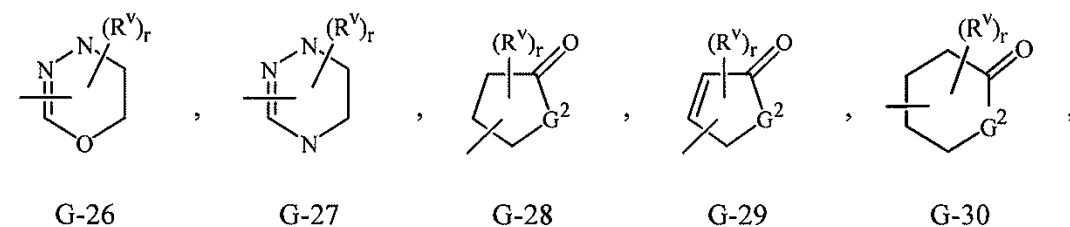
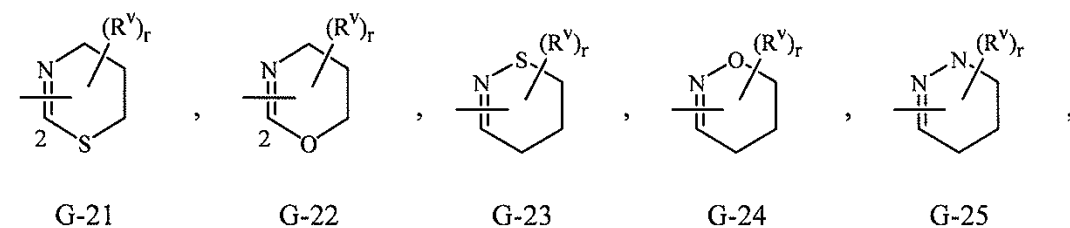
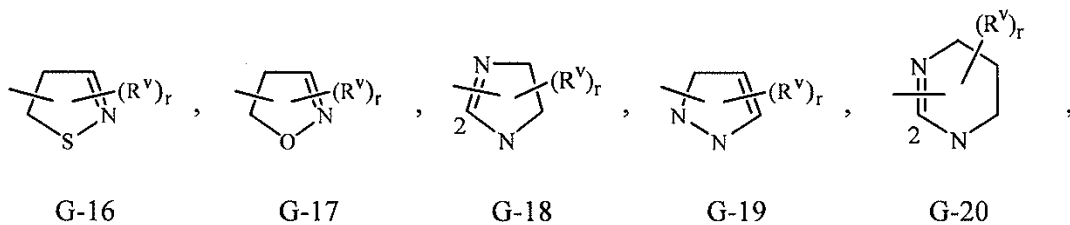
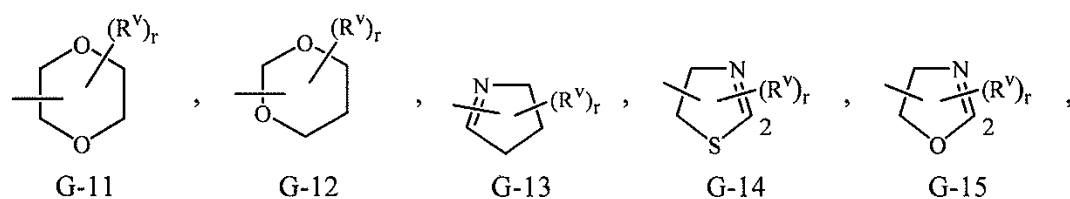
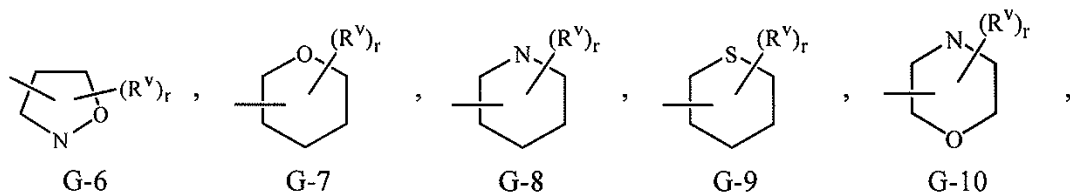
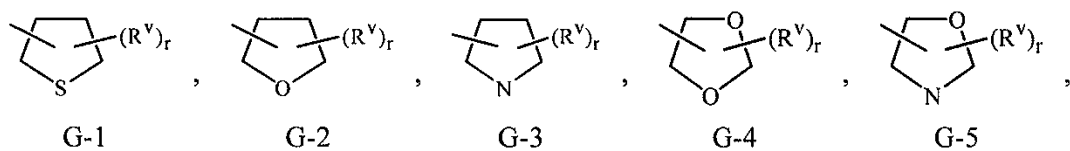
30

40

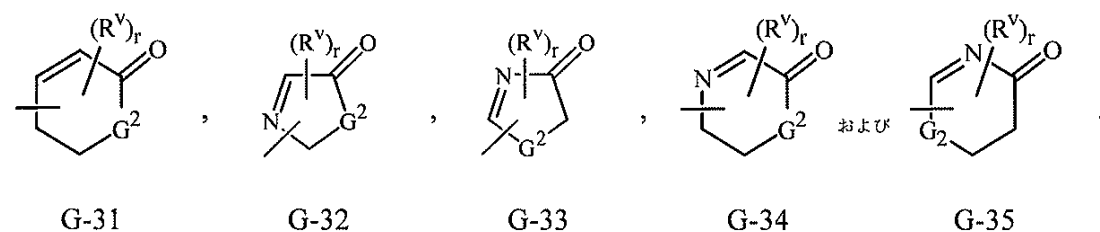
50

## 【化 4】

## 提示 2



## 【化 5】



10

20

30

40

50

## 【 0 0 3 7 】

上記のように、 $Q^1$ または $Q^2$ は、（とりわけ）発明の概要において定義した置換基の群（即ち、炭素原子上の $R^{10}$ または $R^{11}$ および窒素原子上の $R^{12}$ または $R^{13}$ ）から選択される1つまたはそれ以上の置換基で場合により置換されている8、9または10員の縮合二環式環系とすることができる。1つまたはそれ以上の置換基で場合により置換されている8、9または10員の縮合二環式環系の例としては、提示3に図示するような環U-81～U-123が挙げられ、ここで、 $R^v$ は、発明の概要において $Q^1$ または $Q^2$ について定義した任意の置換基（即ち、炭素原子上の $R^{10}$ または $R^{11}$ および窒素原子上の $R^{12}$ または $R^{13}$ ）であり、 $r$ は、典型的には0～5の整数である。

## 【 0 0 3 8 】

10

20

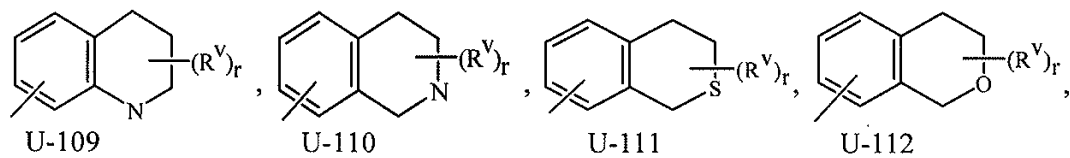
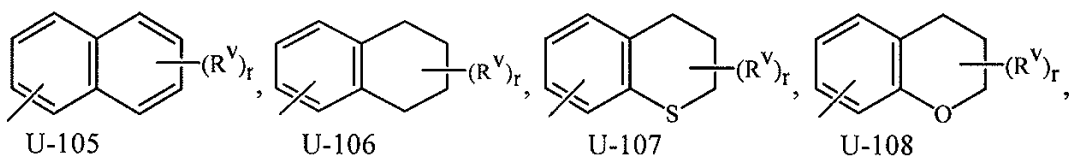
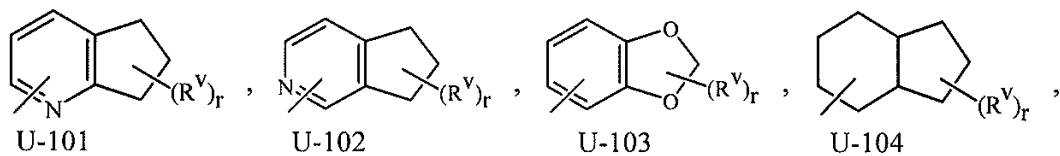
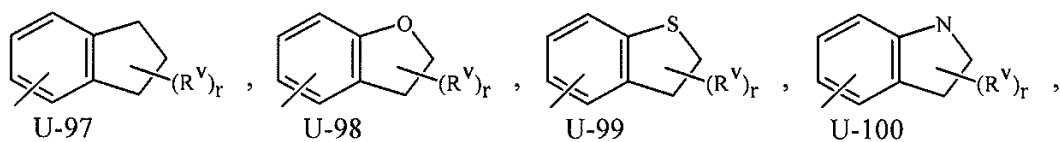
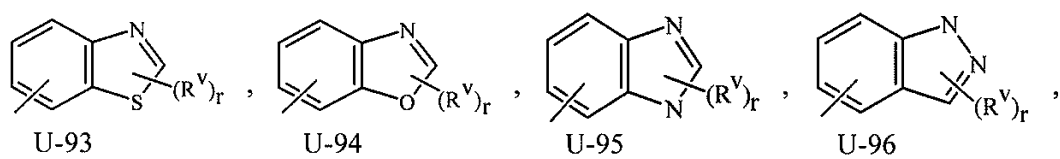
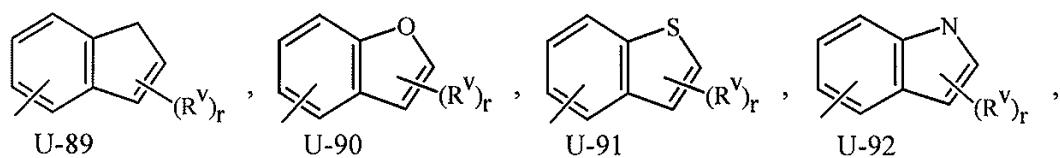
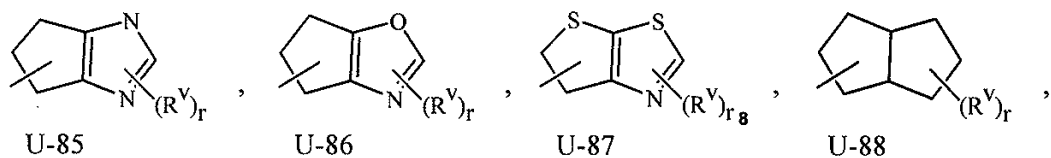
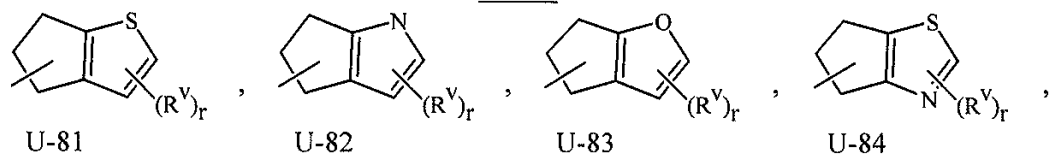
30

40

50

## 【化 6】

提示 3



10

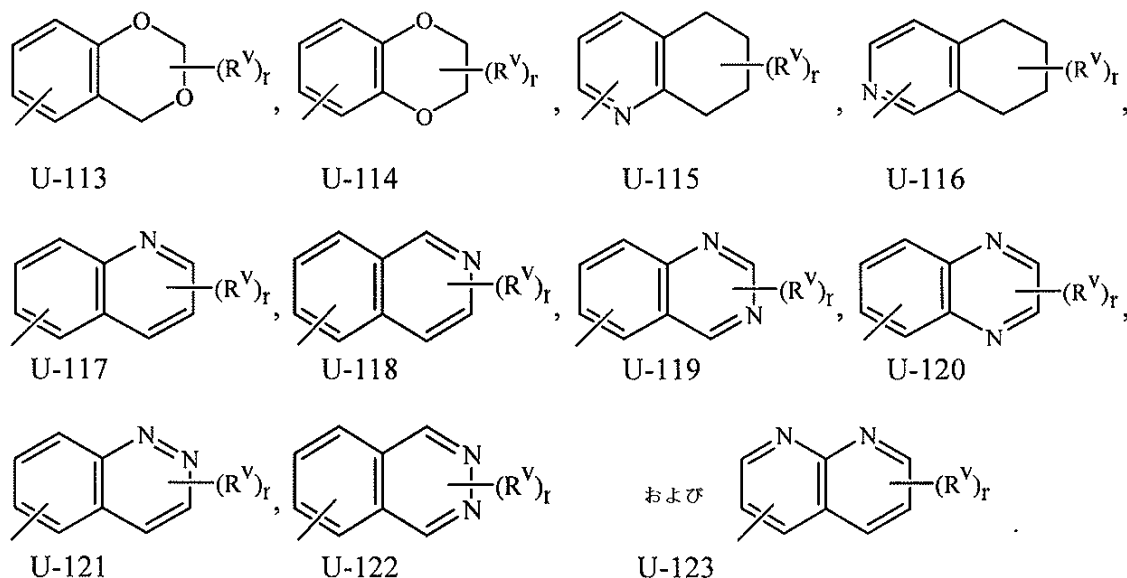
20

30

40

50

## 【化 7】



10

## 【 0 0 3 9】

構造 U - 1 ~ U - 1 2 3 に R<sup>V</sup> 基が示されているが、これらは任意選択の置換基であるため、存在する必要はないことに留意されたい。R<sup>V</sup> が H であり原子に結合している場合、前記原子は非置換であるのと同じであることに留意されたい。置換して原子価を満たす必要のある窒素原子は、H または R<sup>V</sup> で置換される。(R<sup>V</sup>)<sub>r</sub> と U 基との間の結合点が浮遊しているものとして図示されている場合、(R<sup>V</sup>)<sub>r</sub> は、U 基の任意の利用可能な炭素原子または窒素原子に結合可能であることに留意されたい。U 基上の結合点が浮遊しているものとして図示されている場合、U 基は、U 基の任意の利用可能な炭素または窒素を介し、水素原子の置換によって式 1 の残部に結合可能であることに留意されたい。U 基によっては、4 つ未満の R<sup>V</sup> 基（例えば、U - 2 ~ U - 5、U - 7 ~ U - 4 8、および U - 5 2 ~ U - 6 1）でのみで置換できることに留意されたい。

20

## 【 0 0 4 0】

芳香族および非芳香族の複素環式環および環系の製造を可能にする多種多様な合成方法が、当技術分野で公知である；包括的概説については、全 8 巻の Comprehensive Heterocyclic Chemistry、A. R. Katritzky および C. W. Rees 監修、Pergamon Press、Oxford、1984、および全 12 巻の Comprehensive Heterocyclic Chemistry II、A. R. Katritzky、C. W. Rees および E. F. V. Scriven 監修、Pergamon Press、Oxford、1996 を参照されたい。

30

## 【 0 0 4 1】

本発明の化合物は、1 つまたはそれ以上の立体異性体として存在することができる。様々な立体異性体は、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロプ異性体および幾何異性体を含む。立体異性体は、構成が同一であるが、空間における原子の配置が異なる異性体であり、エナンチオマー、ジアステレオマー、シス - トランス異性体（幾何異性体としても公知である）およびアトロプ異性体を含む。アトロプ異性体は、異性体種の単離が可能であるほど回転障壁が十分に大きい単結合周りの束縛回転によって生じる。当業者であれば理解することであるが、1 種の立体異性体が他の立体異性体（複数可）と比して豊富化された場合、または他の立体異性体（複数可）から分離された場合、活性が高まる、および / または有益な効果を発揮することがある。更に、当業者には、前記立体異性体を分離、豊富化、および / または選択的に製造する方法は公知である。本発明の化合物は、立体異性体の混合物、個別の立体異性体、または光学的に活性な形態として存在してもよい。特に、R<sup>4</sup> および R<sup>5</sup> がそれぞれ H である場合、C(O)N(Q<sup>2</sup>)(R<sup>9</sup>) および Q<sup>1</sup> 置

40

50

換基は、典型的にはピロリジノン環上で主に熱力学的に好適なトランス配置にある。

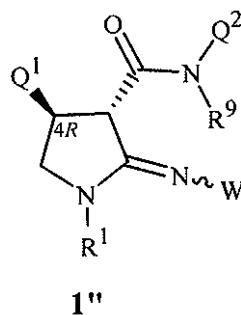
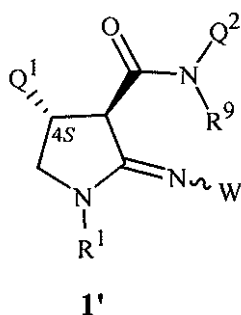
【 0 0 4 2 】

例えば、以下に示すように、環の 3 位の炭素に結合した  $C(O)N(Q^2)(R^9)$  部分 (即ち、両方の Y が O であり; J が  $-CR^2R^3-$  であり、 $R^1$  が H であり、 $R^2$  および  $R^3$  が両方とも H である式 1 の化合物) および環の 4 位の炭素に結合した  $Q^1$  は一般に、トランス配置で見いだされる。これらの 2 個の炭素原子は両方ともキラル中心を有する。最もよく見られるエナンチオマー対が式 1' および式 1'' として示されている。本発明は、全ての立体異性体に関するが、生物学的な実施可能性の点から好適なエナンチオマーは、式 1' であるとされる。立体異性の態様全てに関する包括的考察については、Ernest L. Eliel および Samuel H. Wilen、Stereochemistry of Organic Compounds、John Wiley & Sons、1994 を参照されたい。

10

【 0 0 4 3 】

【化 8】



20

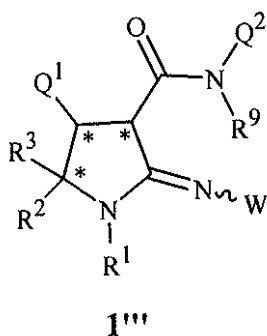
【 0 0 4 4 】

更に、当業者であれば理解することであるが、ピロリジノン環の 5 位の炭素原子 (即ち、J が  $-CR^2R^3-$  である場合、 $R^2$  と  $R^3$  の両方が結合している炭素原子) も、式 1''' に示すように (\*) で表される立体中心を含有する。本発明は、全ての立体異性体に関し、したがって、 $R^2$  または  $R^3$  のいずれかが同じ置換基以外である場合、ジアステレオマーの混合物も可能である。

30

【 0 0 4 5 】

【化 9】



40

【 0 0 4 6 】

本明細書に描かれる分子の描写は、立体化学を描写するための標準的な慣例に従う。立体配置を示すために、図の平面から上方向に観察者に向かう結合は実線のくさびで示され、くさびの幅広端が、図の平面から観察者に向かって上方向にある原子に結合している。図の平面の下方向に観察者から離れた方向に向かう結合は破線のくさびで示され、くさびの幅狭端が、観察者により近い原子に結合している。一定幅の線は、実線または破線のく

50



さびで示される結合に対して反対または中立の方向の結合を示し；一定幅の線は更に、特定の立体配置が指定されることを意図しない分子または分子の一部における結合を表す。

【0047】

本発明は更に、ラセミ混合物、例えば、式1'および1''（また場合によっては1'、1''）のエナンチオマーを等量含む。加えて、本発明は、ラセミ混合物に比べて式1のエナンチオマーが豊富化された化合物を含む。更に、式1の化合物の本質的に純粋なエナンチオマー、例えば、式1'および式1''が含まれる。

【0048】

エナンチオマー豊富化をした場合、一方のエナンチオマーは他方よりも多く存在し、豊富化の程度は、 $(2x - 1) \cdot 100\%$ で定義されるエナンチオマー過剰率（「ee」）という表現によって定義することができ、ここで、xは混合物中の主要なエナンチオマーのモル分率である（例えば、20%のeeは、エナンチオマーの比60：40に相当する）。

10

【0049】

好ましくは、本発明の組成物は、より活性な異性体のエナンチオマー過剰率が少なくとも50%；より好ましくはエナンチオマー過剰率が少なくとも75%；更により好ましくはエナンチオマー過剰率が少なくとも90%；最も好ましくはエナンチオマー過剰率が少なくとも94%である。特に注目すべきは、より活性な異性体のエナンチオマー的に純粋な実施形態である。

【0050】

20

式1の化合物は、追加のキラル中心を含むことができる。例えば、R<sup>A</sup>およびR<sup>B</sup>のような置換基および他の分子構成成分は、それ自体がキラル中心を含有していてもよい。本発明は、ラセミ混合物だけでなく、こうした追加のキラル中心において豊富化された本質的に純粋な立体配置も含む。

【0051】

本発明の化合物は、式1におけるアミド結合（例えば、C(O)N(Q<sup>2</sup>)(R<sup>9</sup>)）周りの束縛回転に起因する1種またはそれ以上の配座異性体として存在することができる。本発明は、配座異性体の混合物を含む。加えて、本発明は、1つの配座異性体が他の異性体に対して豊富化されている化合物を含む。

【0052】

30

エナンチオマー豊富化をした場合、一方のエナンチオマーは他方よりも多く存在し、豊富化の程度は、キラル高速液体クロマトグラフィーによって判定される2種のエナンチオマーの相対面積%として表されるエナンチオマー比（ER）という表現によって定義することができる。

【0053】

好ましくは、本発明の組成物は、より活性な異性体のERが少なくとも50%；より好ましくはERが少なくとも75%；更により好ましくはERが少なくとも90%；最も好ましくはERが少なくとも94%である。特に注目すべきは、より活性な異性体のエナンチオマー的に純粋な実施形態である。

【0054】

40

式1の化合物は、追加のキラル中心を含むことができる。例えば、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>6</sup>のような置換基および他の分子構成成分は、それ自体がキラル中心を含有していてもよい。本発明は、ラセミ混合物だけでなく、こうした追加のキラル中心において豊富化された本質的に純粋な立体配置も含む。

【0055】

式1の化合物は、典型的には2種以上の形態で存在し、したがって、式1は、それが表す化合物の結晶形態および非結晶形態全てを含む。非結晶形態は、ワックスおよびゴムのような固体である実施形態、ならびに溶液および熔融物のような液体である実施形態を含む。結晶形態は、本質的に単結晶型を表す実施形態、および、多形体（即ち、異なる結晶型）の混合物を表す実施形態を含む。「多形体」という用語は、異なる結晶形態で結晶化

50

が可能である化合物の特定の結晶形態を指し、これらの形態は、結晶格子中に分子の異なる配置および/または配座を有する。多形体は同一の化学組成を有する場合があるが、これらは、格子中に弱くまたは強く結合可能な共結晶化水または他の分子の存在または不在により、組成が異なっている場合もある。多形体は、結晶形状、密度、硬度、色、化学的安定性、融点、吸湿性、懸濁性、溶解速度および生物学的利用可能性のような化学的、物理的および生物学的性質が異なっている場合がある。当業者であれば理解することであるが、式1の化合物の多形体は、式1の同一の化合物の他の多形体または多形体の混合物に比して、有益な効果（例えば、有用な製剤の製造に対する適合性、生物学的性能の向上）を示す可能性がある。式1の化合物の特定の多形体の製造および単離は、例えば、選択した溶媒および温度を用いる結晶化を含む、当業者に公知の方法により達成可能である。多形体性に係る包括的な考察については、R. Hilfiker, Ed., *polymorphism in the Pharmaceutical Industry*, Wiley-VCH, Weinheim, 2006を参照されたい。

10

#### 【0056】

当業者であれば理解することであるが、窒素は、酸化物への酸化のためには利用可能な孤立電子対を必要とするため、全ての窒素含有複素環がN-オキシドを形成可能ではない；当業者であれば、N-オキシドを形成可能な窒素含有複素環を認識する。更に、当業者であれば理解することであるが、第三級アミンはN-オキシドを形成可能である。複素環および第三級アミンのN-オキシド製造のための合成方法は当業者に周知であり、過酢酸およびm-クロロ過安息香酸(MCPBA)のようなペルオキシ酸、過酸化水素、t-ブチルヒドロペルオキシドのようなアルキルヒドロペルオキシド、過ホウ酸ナトリウム、ならびにジメチルジオキシランのようなジオキシランによる複素環および第三級アミンの酸化が含まれる。N-オキシドの製造のためのこれらの方法は、文献において広範に記載および概説されており、例えば：T. L. Gilchristの*Comprehensive Organic Synthesis*、第7巻、748～750頁、S. V. Ley編、Pergamon Press；M. TislerおよびB. Stanovnikの*Comprehensive Heterocyclic Chemistry*、第3巻、18～20頁、A. J. BoultonおよびA. McKillop編、Pergamon Press；M. R. GrimmettおよびB. R. T. Keeneの*Advances in Heterocyclic Chemistry*、第43巻、149～161頁、A. R. Katritzky編、Academic Press；M. TislerおよびB. Stanovnikの*Advances in Heterocyclic Chemistry*、第9巻、285～291頁、A. R. KatritzkyおよびA. J. Boulton編、Academic Press；ならびにG. W. H. CheesemanおよびE. S. G. Werstiukの*Advances in Heterocyclic Chemistry*、第22巻、390～392頁、A. R. KatritzkyおよびA. J. Boulton編、Academic Pressを参照されたい。

20

30

#### 【0057】

当業者であれば認識することであるが、環境中、および生理学的条件下では、化合物の塩はその対応する非塩形態と平衡状態にあるので、塩が非塩形態の生物学的有用性を共有する。したがって、式1の化合物の多種多様な塩が、望ましくない植生の防除に有用である（即ち、農学的に適切である）。式1の化合物の塩としては、臭化水素酸、塩酸、硝酸、リン酸、硫酸、酢酸、酪酸、フマル酸、乳酸、マレイン酸、マロン酸、シュウ酸、プロピオン酸、サリチル酸、酒石酸、4-トルエンスルホン酸または吉草酸のような無機酸または有機酸との酸付加塩が挙げられる。式1の化合物がカルボン酸またはフェノールのような酸性部分を含有する場合、塩には、ピリジン、トリエチルアミンもしくはアンモニアのような有機塩基もしくは無機塩基と共に形成された塩、またはナトリウム、カリウム、リチウム、カルシウム、マグネシウムもしくはバリウムのアミド、水素化物、水酸化物または炭酸塩も含まれる。したがって、本発明は、式1から選択される化合物、立体異性体

40

50

、その N - オキシドおよび農業的に適切な塩を含む。

【 0 0 5 8 】

発明の概要に記載の本発明の実施形態は以下の実施形態において用いられる式 1 はその N - オキシドおよび塩を含む場合、以下を含む：

【 0 0 5 9 】

実施形態 1 . 発明の概要に記載の通りである、その全ての立体異性体、N - オキシド、および塩を含む式 1 の化合物、それらを含む農業用組成物、ならびにそれらの除草剤としての使用。

【 0 0 6 0 】

実施形態 2 . W は、 $-NR^A R^B$  である、実施形態 1 の化合物。

10

【 0 0 6 1 】

実施形態 3 . W は、 $-OR^C$  である、実施形態 1 の化合物。

【 0 0 6 2 】

実施形態 4 .  $R^A$  は、H、シアノ、CHO、 $C_2 \sim C_4$  アルキルカルボニルまたは  $C_1 \sim C_4$  アルキルである、実施形態 1 または 2 の化合物。

【 0 0 6 3 】

実施形態 5 .  $R^A$  は、H、CHO、 $C_2 \sim C_4$  アルキルカルボニルまたは  $C_1 \sim C_4$  アルキルである、実施形態 4 の化合物。

【 0 0 6 4 】

実施形態 6 .  $R^A$  は、H または  $C_1 \sim C_4$  アルキルである、実施形態 5 の化合物。

20

【 0 0 6 5 】

実施形態 7 .  $R^A$  は、H または  $CH_3$  である、実施形態 6 の化合物。

【 0 0 6 6 】

実施形態 8 .  $R^A$  は、H である、実施形態 7 の化合物。

【 0 0 6 7 】

実施形態 9 .  $R^A$  は、 $CH_3$  である、実施形態 7 の化合物。

【 0 0 6 8 】

実施形態 10 .  $R^B$  は、H、CHO、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_3 \sim C_6$  アルキニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$  ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノスルホニルもしくは  $C_2 \sim C_8$  ジアルキルアミノスルホニル；または、 $R^{16}$  から独立して選択される 5 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環；または、 $R^{16}$  から独立して選択される 5 個以下の置換基で環員上で置換されているまたは非置換の 5 ～ 6 員複素環式環であり；または

30

$R^A$  および  $R^B$  は、これらが両方とも結合している窒素原子と一緒にあって、炭素、酸素、窒素および  $-C(=O)-$  から選択される環員を含む 5 もしくは 6 員環を形成しており；または、一緒にあって 6 ～ 10 員二環式環系となっている、実施形態 1 ～ 9 のいずれか 1 つの化合物。

40

【 0 0 6 9 】

実施形態 11 .  $R^B$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$  ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノスルホニルもしくは  $C_2 \sim C_8$  ジアルキルアミノスルホニル；または  $R^{16}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；または

50

$R^A$  および  $R^B$  は、これらが両方とも結合している窒素原子と一緒にあって、炭素、酸素および  $-C(=O)-$  から選択される環員を含有する 5 もしくは 6 員環を形成しており；または、一緒にあって 6 ~ 10 員二環式環系となっている、実施形態 10 の化合物。

【0070】

実施形態 12 .  $R^B$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$  ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノスルホニルもしくは  $C_2 \sim C_8$  ジアルキルアミノスルホニル；または  $R^{16}$  から独立して選択される 3 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；

10

$R^A$  および  $R^B$  は、これらが両方とも結合している窒素原子と一緒にあって、炭素および酸素から選択される環員を含有する 5 員環を形成しており；または、一緒にあって 6 ~ 9 員二環式環系となっている、実施形態 11 の化合物。

【0071】

実施形態 13 .  $R^B$  は、H、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニルもしくは  $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシカルボニル；または  $R^{16}$  から独立して選択される 3 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環である、実施形態 12 の化合物。

【0072】

20

実施形態 14 .  $R^B$  は、H または  $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニルである、実施形態 13 の化合物。

【0073】

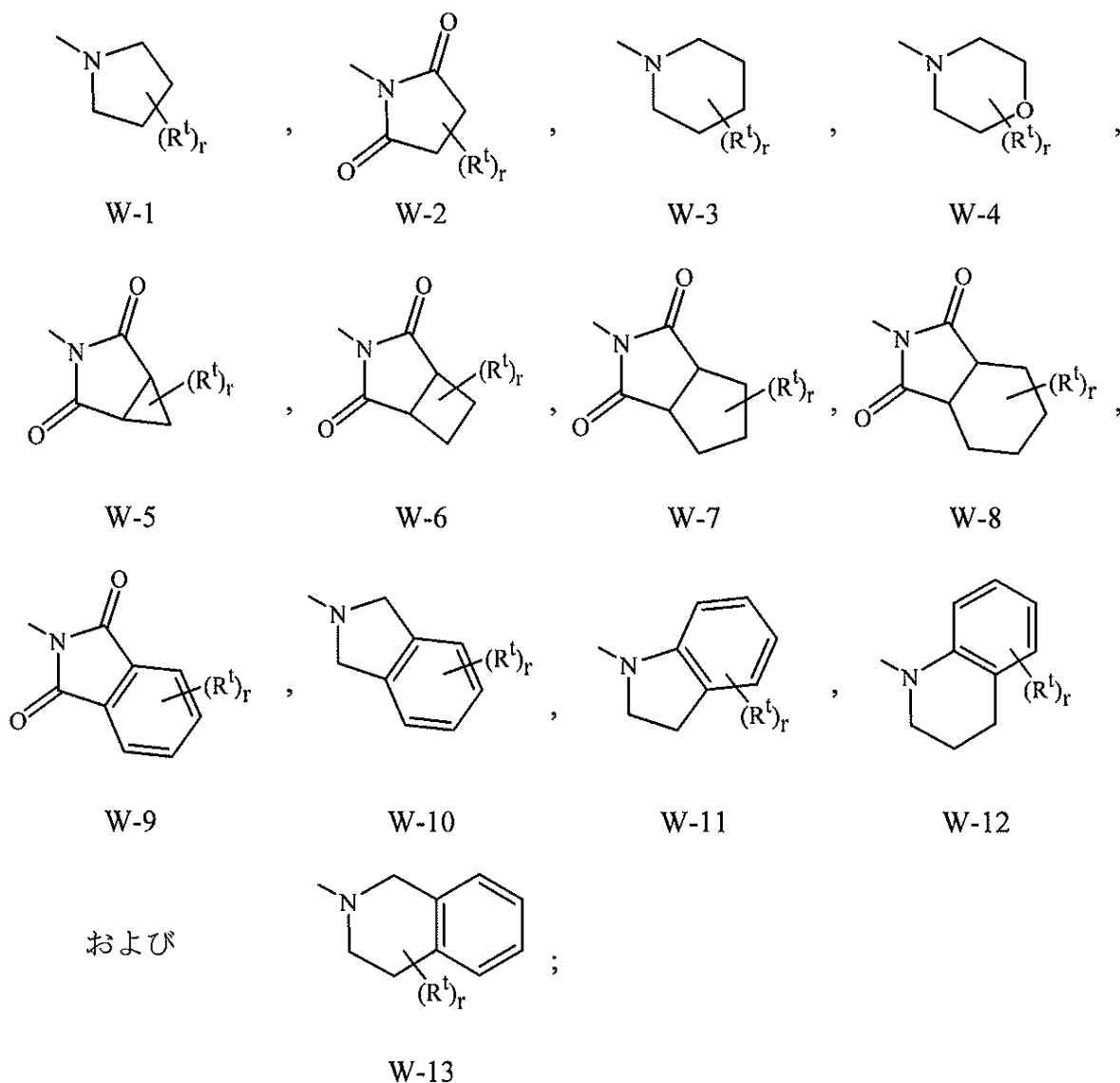
実施形態 15 .  $R^A$  および  $R^B$  は、これらが両方とも結合している窒素原子と一緒にあって、炭素および酸素および  $-C(=O)-$  から選択される環員を含有する 5 もしくは 6 員環を形成しており；または、一緒にあって

30

40

50

## 【化 10】



からなる群から選択される 6 ~ 10 員二環式環系となっており；

$R^t$  は、ハロゲン、シアノまたは  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり；

$r$  は、0 ~ 4 である、実施形態 1 または 2 の化合物。

## 【0074】

実施形態 16 .  $R^A$  および  $R^B$  は、一緒になって W - 7、W - 8 および W - 9 から選択される 8 ~ 9 員二環式環系となっており； $R^t$  は、ハロゲンまたは  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり； $r$  は、0 ~ 3 である、実施形態 15 の化合物。

## 【0075】

実施形態 17 .  $R^A$  および  $R^B$  は、一緒になって W - 9 から選択される 9 員二環式環系となっており； $R^t$  は、F、Cl、Br または  $CH_3$  であり； $r$  は、0 ~ 2 である、実施形態 15 の化合物。

## 【0076】

実施形態 18 .  $R^C$  は、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$  ハロアルキルカルボニルもしくは  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル；またはハロゲンもしくは  $C_1 \sim C_4$  アルキルで置換されているまたは非置換のフェニル；またはハロゲンもしくは  $C_1 \sim C_4$  アルキルで置換されているまたは非置換の 6 員窒素含有芳香族環である、実施形態 1 ~ 3 のいずれか 1 つの化合物。

## 【 0 0 7 7 】

実施形態 19 .  $R^C$  は、 $CF_3$ 、 $-C(=O)CF_3$  もしくはシクロプロピル；またはハロゲンもしくは  $C_1 \sim C_4$  アルキルで置換されているまたは非置換のフェニル；または非置換のピリジンもしくはピリミジン環である、実施形態 18 の化合物。

## 【 0 0 7 8 】

実施形態 20 .  $R^C$  は、 $CF_3$ ；またはハロゲンで置換されているまたは非置換のフェニル；または非置換のピリジン環である、実施形態 19 の化合物。

## 【 0 0 7 9 】

実施形態 21 .  $J$  は、 $-CR^2R^3-$ 、 $-CR^2R^3-CR^4R^5-$  または  $-NR^6-$  である、実施形態 1 ~ 20 のいずれか 1 つの化合物。

10

## 【 0 0 8 0 】

実施形態 22 .  $J$  は、 $-CR^2R^3-$  または  $-CR^2R^3-CR^4R^5-$  である、実施形態 21 の化合物。

## 【 0 0 8 1 】

実施形態 23 .  $J$  は、 $-CR^2R^3-CR^4R^5-$  である、実施形態 22 の化合物。

## 【 0 0 8 2 】

実施形態 24 .  $J$  は、 $-CR^2R^3-$  である、実施形態 22 の化合物。

## 【 0 0 8 3 】

実施形態 25 .  $Y$  は、 $O$  または  $S$  である、実施形態 1 ~ 24 のいずれか 1 つの化合物。

## 【 0 0 8 4 】

実施形態 26 .  $Y$  は、 $S$  である、実施形態 25 の化合物。

20

## 【 0 0 8 5 】

実施形態 27 .  $Y$  は、 $O$  である、実施形態 25 の化合物。

## 【 0 0 8 6 】

実施形態 28 .  $R^1$  は、 $H$ 、 $CHO$ 、 $C_3 \sim C_8$  アルキルカルボニルアルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_3 \sim C_6$  アルキニル、 $C_2 \sim C_6$  シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$  シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$  アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$  ジアルキルアミノカルボニルまたは  $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルアミノカルボニルである、実施形態 1 ~ 27 のいずれか 1 つの化合物。

30

## 【 0 0 8 7 】

実施形態 29 .  $R^1$  は、 $H$ 、 $C_3 \sim C_8$  アルキルカルボニルアルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$  シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$  シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニルまたは  $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシカルボニルである、実施形態 28 の化合物。

40

## 【 0 0 8 8 】

実施形態 30 .  $R^1$  は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$  シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$  シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシアルキルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニルである、実施形態 29 の化合物。

## 【 0 0 8 9 】

実施形態 31 .  $R^1$  は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$  シクロアルキルアルキルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキルである、実施形態 30 の化合物。

## 【 0 0 9 0 】

50

実施形態 32 .  $R^1$  は、 $H$ 、 $CH_3$ 、 $CH_2CH_3$ 、シクロプロピル、シクロプロピルメチルまたは  $CH_2OCH_3$  である、実施形態 31 の化合物。

【0091】

実施形態 33 .  $Q^1$  は、フェニル環もしくはナフタレニル環系であり、各環もしくは環系は、 $R^{10}$  から独立して選択される 5 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または、5 ~ 6 員複素環式環；もしくは 8 ~ 10 員二環式環系であり、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに 2 個以下の O 原子、2 個以下の S 原子および 4 個以下の N 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2 個以下の炭素環員は  $C(=O)$  および  $C(=S)$  から独立して選択され、硫黄原子環員は  $S(=O)_u(=NR^{14})_v$  から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で  $R^{10}$  から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で  $R^{12}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換である、実施形態 1 ~ 32 のいずれか 1 つの化合物。

10

【0092】

実施形態 34 .  $Q^1$  は、 $R^{10}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；または、5 ~ 6 員複素環式環であり、各環は、炭素原子、ならびに 2 個以下の O 原子、2 個以下の S 原子および 4 個以下の N 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、各環は、炭素原子環員上で  $R^{10}$  から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で  $R^{12}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換である、実施形態 33 の化合物。

20

【0093】

実施形態 35 .  $Q^1$  は、 $R^{10}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環である、実施形態 34 の化合物。

【0094】

実施形態 36 .  $Q^1$  は、 $R^{10}$  から独立して選択される 3 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環である、実施形態 35 の化合物。

【0095】

実施形態 37 .  $Q^1$  は、 $R^{10}$  から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環である、実施形態 36 の化合物。

【0096】

実施形態 38 .  $Q^1$  は、 $R^{10}$  から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換されたフェニル環である、実施形態 37 の化合物。

30

【0097】

実施形態 39 .  $Q^1$  は、 $R^{10}$  から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換されたフェニル環であり、ここで、1 個の置換基はパラ (4) 位置にある、実施形態 38 の化合物。

【0098】

実施形態 40 .  $Q^1$  は、 $R^{10}$  から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換されたフェニル環であり、ここで、1 個の置換基はメタ (3) 位置にある、実施形態 38 の化合物。

【0099】

実施形態 41 .  $Q^1$  は、非置換のフェニル環以外である、実施形態 1 ~ 40 のいずれか 1 つの化合物。

40

【0100】

実施形態 42 .  $Q^1$  は、炭素原子および 2 個以下の O 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有する 8 ~ 10 員二環式環系であり、各二環式環系は、炭素原子環員上で  $R^{10}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換である、実施形態 33 の化合物。

【0101】

実施形態 43 .  $Q^1$  は、炭素原子および 2 個以下の O 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有する 9 員二環式環系であり、各二環式環系は、炭素原子環員上で  $R^{10}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているま

50

たは非置換である、実施形態 4 2 の化合物。

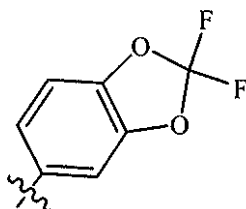
【 0 1 0 2 】

実施形態 4 4 .  $Q^1$  は、炭素原子および 2 個の O 原子から選択される環員を含有する 9 員複素芳香族二環式環系であり、各二環式環系は、炭素原子環員上で  $R^{10}$  から独立して選択される 3 個以下の置換基で置換されているまたは非置換である（即ち、提示 3 の U - 1 0 3 ）、実施形態 4 3 の化合物。

【 0 1 0 3 】

実施形態 4 5 .  $Q^1$  は、U - 1 0 3 A :

【 化 1 1 】



U-103A

10

である、実施形態 4 4 の化合物。

【 0 1 0 4 】

実施形態 4 6 .  $Q^2$  は、フェニル環であり、各環は、 $R^{11}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または、5 ~ 6 員複素環式環；もしくは 8 ~ 10 員二環式環系であり、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに 2 個以下の O 原子、2 個以下の S 原子および 4 個以下の N 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2 個以下の炭素環員は  $C(=O)$  および  $C(=S)$  から独立して選択され、硫黄原子環員は  $S(=O)_u(=NR^{14})_v$  から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で  $R^{11}$  から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で  $R^{13}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換である、実施形態 1 ~ 4 5 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 1 0 5 】

実施形態 4 7 .  $Q^2$  は、 $R^{11}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；または、5 ~ 6 員複素環式環；もしくは 8 ~ 10 員二環式環系であり、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに 2 個以下の O 原子、2 個以下の S 原子および 4 個以下の N 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2 個以下の炭素環員は  $C(=O)$  および  $C(=S)$  から独立して選択され、硫黄原子環員は  $S(=O)_u(=NR^{14})_v$  から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で  $R^{11}$  から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で  $R^{13}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換である、実施形態 4 6 の化合物。

【 0 1 0 6 】

実施形態 4 8 .  $Q^2$  は、 $R^{11}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；または、炭素原子および 4 個以下の N 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有する 5 ~ 6 員複素環式環であり、ここで、2 個以下の炭素環員は  $C(=O)$  および  $C(=S)$  から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で  $R^{11}$  から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で  $R^{13}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換である、実施形態 4 7 の化合物。

【 0 1 0 7 】

実施形態 4 9 .  $Q^2$  は、 $R^{11}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環である、実施形態 4 8 の化合物。

20

30

40

50



## 【 0 1 0 8 】

実施形態 50 .  $Q^2$  は、 $R^{11}$  から独立して選択される 3 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環である、実施形態 49 の化合物。

## 【 0 1 0 9 】

実施形態 51 .  $Q^2$  は、 $R^{11}$  から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環である、実施形態 50 の化合物。

## 【 0 1 1 0 】

実施形態 52 .  $Q^2$  は、 $R^{11}$  から独立して選択される少なくとも 2 個の置換基で置換されたフェニル環であり、ここで、1 個の置換基はオルト ( 2 ) 位置にある、実施形態 51 の化合物。

10

## 【 0 1 1 1 】

実施形態 53 .  $Q^2$  は、 $R^{11}$  から独立して選択される少なくとも 2 個の置換基で置換されたフェニル環であり、ここで、1 個の置換基はメタ ( 3 ) 位置にある、実施形態 52 の化合物。

## 【 0 1 1 2 】

実施形態 54 .  $Q^2$  は、非置換のフェニル環以外である、実施形態 1 ~ 53 のいずれか 1 つの化合物。

## 【 0 1 1 3 】

実施形態 55 .  $R^2$  および  $R^3$  は、それぞれ独立して H または  $C_1 \sim C_4$  アルキルである、実施形態 1 ~ 54 のいずれか 1 つの化合物。

20

## 【 0 1 1 4 】

実施形態 56 .  $R^2$  および  $R^3$  は、それぞれ独立して H または  $CH_3$  である、実施形態 55 の化合物。

## 【 0 1 1 5 】

実施形態 57 .  $R^2$  および  $R^3$  は、それぞれ独立して H である、実施形態 56 の化合物。

## 【 0 1 1 6 】

実施形態 58 .  $R^4$  および  $R^5$  は、それぞれ独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  アルキルまたは  $C_1 \sim C_4$  アルコキシである、実施形態 1 ~ 57 のいずれか 1 つの化合物。

## 【 0 1 1 7 】

実施形態 59 .  $R^4$  および  $R^5$  は、それぞれ独立して H、ハロゲンまたは  $C_1 \sim C_4$  アルキルである、実施形態 58 の化合物。

30

## 【 0 1 1 8 】

実施形態 60 .  $R^4$  および  $R^5$  は、それぞれ独立して H、 $Cl$  または  $CH_3$  である、実施形態 59 の化合物。

## 【 0 1 1 9 】

実施形態 61 .  $R^6$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキルまたは  $C_1 \sim C_6$  アルコキシである、実施形態 1 ~ 60 のいずれか 1 つの化合物。

## 【 0 1 2 0 】

実施形態 62 .  $R^6$  は、H または  $C_1 \sim C_6$  アルキルである、実施形態 61 の化合物。

## 【 0 1 2 1 】

実施形態 63 .  $R^6$  は、H または  $CH_3$  である、実施形態 62 の化合物。

40

## 【 0 1 2 2 】

実施形態 64 .  $R^6$  は、H である、実施形態 63 の化合物。

## 【 0 1 2 3 】

実施形態 65 .  $R^1$  および  $R^6$  は、一緒になって  $C_3$  アルキレンまたは  $-CH_2OCH_2-$  となっている、実施形態 1 ~ 27 または 33 ~ 60 のいずれか 1 つの化合物。

## 【 0 1 2 4 】

実施形態 66 .  $R^1$  および  $R^6$  は、一緒になって  $C_3$  アルキレンとなっている、実施形態 65 の化合物。

## 【 0 1 2 5 】

50

実施形態 67 .  $R^7$  および  $R^8$  は、それぞれ独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  アルコキシまたは  $C_1 \sim C_4$  アルキルである、実施形態 1 ~ 66 のいずれか 1 つの化合物。

【0126】

実施形態 68 .  $R^7$  および  $R^8$  は、それぞれ独立して H、F、Cl または  $CH_3$  である、実施形態 67 の化合物。

【0127】

実施形態 69 .  $R^7$  および  $R^8$  は、それぞれ独立して H または  $CH_3$  である、実施形態 68 の化合物。

【0128】

実施形態 70 .  $R^7$  および  $R^8$  は、それぞれ独立して H である、実施形態 69 の化合物。

10

【0129】

実施形態 71 .  $R^9$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニルまたは  $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシカルボニルである、実施形態 1 ~ 70 のいずれか 1 つの化合物。

【0130】

実施形態 72 .  $R^9$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニルである、実施形態 71 の化合物。

20

【0131】

実施形態 73 .  $R^9$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニルである、実施形態 72 の化合物。

【0132】

実施形態 74 .  $R^9$  は、H、 $CH_3$  または  $-C(=O)OCH_3$  である、実施形態 73 の化合物。

【0133】

実施形態 75 .  $R^9$  は、H である、実施形態 74 の化合物。

【0134】

実施形態 76 . 各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、ハロゲン、ニトロ、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_1 \sim C_8$  シアノアルキル、 $C_1 \sim C_8$  シアノアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_8$  ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$  ニトロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$  アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシハロアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$  ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$  アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$  シクロアルキルアルケニル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$  アルキルシクロアルキル、 $C_6 \sim C_{12}$  シクロアルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$  ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニル、 $-C(=O)OH$ 、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$  シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $-C(=O)NH_2$ 、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_8$  ハロシクロアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$  アルキルカルボニルアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルキルカルボニルオキシ、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルキルスルホニルまたは  $C_3 \sim C_8$  シクロアルキ

30

40

50

ルスルホニルである、実施形態 1 ~ 75 のいずれか 1 つの化合物。

【0135】

実施形態 77 . 各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$  アルコキシアルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$  アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  ハロシクロアルキル、 $C_6 \sim C_{12}$  シクロアルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$  シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_8$  ハロシクロアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$  アルキルカルボニルアルコキシまたは  $C_2 \sim C_8$  ハロアルキルカルボニルオキシである、実施形態 76 の化合物。

10

【0136】

実施形態 78 . 各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$  アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルコキシまたは  $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルコキシである、実施形態 77 の化合物。

20

【0137】

実施形態 79 . 各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシまたは  $C_1 \sim C_8$  ハロアルコキシである、実施形態 78 の化合物。

【0138】

実施形態 80 . 各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシまたは  $C_1 \sim C_8$  ハロアルコキシである、実施形態 79 の化合物。

30

【0139】

実施形態 81 . 各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立してハロゲンまたは  $C_1 \sim C_8$  アルキルである、実施形態 80 の化合物。

【0140】

実施形態 82 . 各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立してハロゲンまたは  $C_1 \sim C_8$  ハロアルキルである、実施形態 81 の化合物。

【0141】

実施形態 83 . 各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立してハロゲンまたは  $C_1 \sim C_8$  アルコキシである、実施形態 80 の化合物。

【0142】

実施形態 84 . 各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立してハロゲンまたは  $C_1 \sim C_8$  ハロアルコキシである、実施形態 80 の化合物。

40

【0143】

実施形態 85 . 各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立して  $C_1 \sim C_8$  アルキルまたは  $C_1 \sim C_8$  アルコキシである、実施形態 80 の化合物。

【0144】

実施形態 86 . 各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立して  $C_1 \sim C_8$  アルキルまたは  $C_1 \sim C_8$  ハロアルキルである、実施形態 80 の化合物。

【0145】

実施形態 87 . 各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  は、独立して  $C_1 \sim C_3$  アルキル、 $C_2 \sim C_3$  アル

50

ケニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_3$ アルキルアミノアルキルである、実施形態 1 ~ 86 のいずれか 1 つの化合物。

【0146】

実施形態 88 . 各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  は、独立して  $C_1 \sim C_3$  アルキル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルまたは  $C_2 \sim C_3$  アルキルカルボニルである、実施形態 87 の化合物。

【0147】

実施形態 89 . 各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  は、独立して  $C_1 \sim C_3$  アルキルまたは  $C_2 \sim C_3$  アルキルカルボニルである、実施形態 88 の化合物。

【0148】

実施形態 90 . 各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  は、独立して  $C_1 \sim C_3$  アルキルである、実施形態 89 の化合物。

【0149】

実施形態 91 . 各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  は、独立して  $CH_3$  である、実施形態 90 の化合物。

【0150】

実施形態 92 . 各  $R^{14}$  は、独立して H または  $-(C=O)CH_3$  である、実施形態 1 ~ 91 のいずれか 1 つの化合物。

【0151】

実施形態 93 . 各  $R^{14}$  は、独立して H である、実施形態 92 の化合物。

【0152】

実施形態 94 .  $R^{15}$  は、H、 $CHO$ 、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルキルカルボニルまたは  $C_2 \sim C_6$  ハロアルキルカルボニルである、実施形態 1 ~ 93 のいずれか 1 つの化合物。

【0153】

実施形態 95 .  $R^{15}$  は、H、 $CH_3$ 、 $-(C=O)CH_3$  または  $-(C=O)CF_3$  である、実施形態 94 の化合物。

【0154】

実施形態 96 . 各  $R^{15}$  は、独立して H または  $CH_3$  である、実施形態 95 の化合物。

【0155】

実施形態 97 . 各  $R^{16}$ 、 $R^{17}$  および  $R^{18}$  は、独立してハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_2 \sim C_6$  アルキニル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_8$  ヒドロキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$  アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルキルアミノアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$  シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$  ジアルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$  ジアルキルアミノアルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニルオキシまたは  $C_1 \sim C_6$  アルキルチオである、実施形態 1 ~ 96 のいずれか 1 つの化合物。

【0156】

実施形態 98 . 各  $R^{16}$ 、 $R^{17}$  および  $R^{18}$  は、独立してハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキルまたは  $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルである、実施形態 97 の化合物。

【0157】

実施形態 99 . 各  $R^{16}$ 、 $R^{17}$  および  $R^{18}$  は、独立してハロゲン、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルまたは  $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルである、実施形態 98 の化合物。

【0158】

実施形態 100 . 各  $R^{16}$ 、 $R^{17}$  および  $R^{18}$  は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アル

10

20

30

40

50

キルまたは  $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルである、実施形態 99 の化合物。

【0159】

実施形態 101 . 各  $R^{16}$ 、 $R^{17}$  および  $R^{18}$  は、独立してハロゲンまたは  $C_1 \sim C_6$  アルキルである、実施形態 100 の化合物。

【0160】

実施形態 102 . 各  $R^{16}$ 、 $R^{17}$  および  $R^{18}$  は、独立してハロゲンである、実施形態 101 の化合物。

【0161】

実施形態 103 .  $u$  と  $v$  の合計は 0 である、実施形態 1 ~ 102 のいずれか 1 つの化合物。

【0162】

実施形態 104 .  $u$  と  $v$  の合計は 2 である、実施形態 1 ~ 102 のいずれか 1 つの化合物。

【0163】

本発明の実施形態は、上記実施形態 1 ~ 104 だけでなく本明細書に記載する他の任意の実施形態も含め、どのように組み合わせることも可能であり、実施形態における可変要素についての説明は、式 1 の化合物だけでなく、式 1 の化合物の製造に有用な出発化合物および中間化合物にも関連する。加えて、本発明の実施形態は、上記実施形態 1 ~ 104 だけでなく本明細書に記載する他の任意の実施形態およびそれらの任意の組合せも含め、本発明の組成物および方法に関連する。

【0164】

実施形態 A .

$R^A$  は、H、シアノ、CHO、 $C_2 \sim C_4$  アルキルカルボニルまたは  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり；

$R^B$  は、H、CHO、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_3 \sim C_6$  アルキニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$  ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノスルホニルもしくは  $C_2 \sim C_8$  ジアルキルアミノスルホニル；または、 $R^{16}$  から独立して選択される 5 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環；または、 $R^{16}$  から独立して選択される 5 個以下の置換基で環員上で置換されているまたは非置換の 5 ~ 6 員複素環式環であり；または

$R^A$  および  $R^B$  は、これらが両方とも結合している窒素原子と一緒にあって、炭素、酸素、窒素および  $-C(=O)-$  から選択される環員を含有する 5 もしくは 6 員環を形成しており；または、一緒にあって 6 ~ 10 員二環式環系となっており；

$R^C$  は、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$  ハロアルキルカルボニルもしくは  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル；またはハロゲンもしくは  $C_1 \sim C_4$  アルキルで置換されているまたは非置換のフェニル；またはハロゲンもしくは  $C_1 \sim C_4$  アルキルで置換されているまたは非置換の 6 員窒素含有芳香族環であり；

J は、 $-CR^2R^3-$ 、 $-CR^2R^3-CR^4R^5-$  または  $-NR^6-$  であり；

Y は、O または S であり；

$R^1$  は、H、CHO、 $C_3 \sim C_8$  アルキルカルボニルアルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_3 \sim C_6$  アルキニル、 $C_2 \sim C_6$  シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$  シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$  アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシ

10

20

30

40

50

カルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$  ジアルキルアミノカルボニルまたは $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルアミノカルボニルであり；

$Q^1$  は、フェニル環もしくはナフタレニル環系であり、各環もしくは環系は、 $R^{10}$  から独立して選択される 5 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または、5 ～ 6 員複素環式環；もしくは 8 ～ 10 員二環式環系であり、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに 2 個以下の O 原子、2 個以下の S 原子および 4 個以下の N 原子から独立して選択される 1 ～ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2 個以下の炭素環員は  $C(=O)$  および  $C(=S)$  から独立して選択され、硫黄原子環員は  $S(=O)_u$  ( $=NR^{14}$ )<sub>v</sub> から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で  $R^{10}$  から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で  $R^{12}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；

10

$Q^2$  は、フェニル環であり、各環は、 $R^{11}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；または、5 ～ 6 員複素環式環；もしくは 8 ～ 10 員二環式環系であり、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに 2 個以下の O 原子、2 個以下の S 原子および 4 個以下の N 原子から独立して選択される 1 ～ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2 個以下の炭素環員は  $C(=O)$  および  $C(=S)$  から独立して選択され、硫黄原子環員は  $S(=O)_u$  ( $=NR^{14}$ )<sub>v</sub> から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で  $R^{11}$  から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で  $R^{13}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；

20

$R^2$  および  $R^3$  は、それぞれ独立して H または  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり；

$R^4$  および  $R^5$  は、それぞれ独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  アルキルまたは  $C_1 \sim C_4$  アルコキシであり；

$R^6$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキルまたは  $C_1 \sim C_6$  アルコキシであり；

$R^7$  および  $R^8$  は、それぞれ独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  アルコキシまたは  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり；

$R^9$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニルまたは  $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシカルボニルであり；

30

各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、ハロゲン、ニトロ、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_1 \sim C_8$  シアノアルキル、 $C_1 \sim C_8$  シアノアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_8$  ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$  ニトロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$  アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシハロアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$  ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$  アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$  シクロアルキルアルケニル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$  アルキルシクロアルキル、 $C_6 \sim C_{12}$  シクロアルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$  ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニル、 $-C(=O)OH$ 、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$  シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $-C(=O)NH_2$ 、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_8$  ハロシクロアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$  アルキルカルボニルアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルキルカルボニルオキシ、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$  ハ

40

50

ロアルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニルまたは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニルであり；

各 $R^{12}$ および $R^{13}$ は、独立して $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニルまたは $C_2 \sim C_3$ アルキルアミノアルキルであり；

各 $R^{14}$ は、独立してHまたは $-(C=O)CH_3$ であり；

各 $R^{16}$ は、独立してハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_8$ ヒドロキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルチオであり；

uとvの合計は2である、

式1の化合物。

【0165】

実施形態B。

$R^A$ は、H、 $CHO$ 、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニルまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

$R^B$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニルもしくは $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニル；または $R^{16}$ から独立して選択される4個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；または

$R^A$ および $R^B$ は、これらが両方とも結合している窒素原子と一緒に炭素、酸素および $-C(=O)-$ から選択される環員を含有する5もしくは6員環を形成しており；または、一緒に炭素、酸素と一緒になって6～10員二環式環系となっており；

$R^C$ は、 $CF_3$ 、 $-C(=O)CF_3$ もしくはシクロプロピル；またはハロゲンもしくは $C_1 \sim C_4$ アルキルで置換されているまたは非置換のフェニル；または非置換のピリジンもしくはピリミジン環であり；

Jは、 $-CR^2R^3-$ または $-CR^2R^3-CR^4R^5-$ であり；

Yは、Oであり；

$R^1$ は、H、 $C_3 \sim C_8$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニルまたは $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニルであり；

$Q^1$ は、 $R^{10}$ から独立して選択される4個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；または、5～6員複素環式環であり、各環は、炭素原子、ならびに2個以下のO原子、2個以下のS原子および4個以下のN原子から独立して選択される1～4個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、各環は、炭素原子環員上で $R^{10}$ から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で $R^{12}$ から独立して選択される4個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；

$Q^2$ は、 $R^{11}$ から独立して選択される4個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；または、5～6員複素環式環；もしくは8～10員二環式環系であ

り、各環もしくは環系は、炭素原子、ならびに 2 個以下の O 原子、2 個以下の S 原子および 4 個以下の N 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、2 個以下の炭素環員は  $C(=O)$  および  $C(=S)$  から独立して選択され、硫黄原子環員は  $S(=O)_u(=NR^{14})_v$  から独立して選択され、各環もしくは環系は、炭素原子環員上で  $R^{11}$  から独立して選択されるおよび窒素原子環員上で  $R^{13}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換であり；

$R^2$  および  $R^3$  は、それぞれ独立して H または  $CH_3$  であり；

$R^4$  および  $R^5$  は、それぞれ独立して H、ハロゲンまたは  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり；

$R^7$  および  $R^8$  は、それぞれ独立して H、F、Cl または  $CH_3$  であり；

$R^9$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニルであり；

10

各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$  アルコキシアルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$  アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  ハロシクロアルキル、 $C_6 \sim C_{12}$  シクロアルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$  シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_8$  ハロシクロアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$  アルキルカルボニルアルコキシまたは  $C_2 \sim C_8$  ハロアルキルカルボニルオキシであり；

20

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  は、独立して  $C_1 \sim C_3$  アルキル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルまたは  $C_2 \sim C_3$  アルキルカルボニルであり；

各  $R^{14}$  は、独立して H であり；

各  $R^{16}$  は、独立してハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキルまたは  $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルである、

実施形態 A の化合物。

30

#### 【0166】

実施形態 C .

W は、 $NR^A R^B$  であり；

$R^A$  は、H または  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり；

$R^B$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$  ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノスルホニルもしくは  $C_2 \sim C_8$  ジアルキルアミノスルホニル；または  $R^{16}$  から独立して選択される 3 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；

40

$R^A$  および  $R^B$  は、これらが両方とも結合している窒素原子と一緒にあって、炭素および酸素から選択される環員を含有する 5 員環を形成しており；または、一緒にあって 6 ~ 9 員二環式環系となっており；

J は、 $-CR^2 R^3-$  であり；

$R^1$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$  シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$  シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコキシアルキルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニルであり；

$Q^1$  は、 $R^{10}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換

50



のフェニル環であり；

$Q^2$  は、 $R^{11}$  から独立して選択される 4 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；

$R^2$  および  $R^3$  は、それぞれ独立して H または  $CH_3$  であり；

$R^7$  および  $R^8$  は、それぞれ独立して H または  $CH_3$  であり；

$R^9$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニルであり；

各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルコシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$  アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$  ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_8$  ハロアルコシアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルコキシまたは  $C_2 \sim C_8$  アルコシアルコキシであり；

各  $R^{12}$  および  $R^{13}$  は、独立して  $C_1 \sim C_3$  アルキルまたは  $C_2 \sim C_3$  アルキルカルボニルであり；

各  $R^{16}$  は、独立してハロゲン、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルまたは  $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルである、

実施形態 B の化合物。

#### 【0167】

実施形態 D .

$R^A$  は、H または  $CH_3$  であり；

$R^B$  は、H、 $C_2 \sim C_8$  アルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニルもしくは  $C_4 \sim C_{10}$  シクロアルコキシカルボニル；または  $R^{16}$  から独立して選択される 3 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；

$R^1$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$  シクロアルキルアルキルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルコシアルキルであり；

$Q^1$  は、 $R^{10}$  から独立して選択される 3 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；

$Q^2$  は、 $R^{11}$  から独立して選択される 3 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；

$R^2$  および  $R^3$  は、それぞれ独立して H であり；

$R^7$  および  $R^8$  は、それぞれ独立して H または F であり；

$R^9$  は、H、 $CH_3$  または  $-C(=O)OCH_3$  であり；

各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシまたは  $C_1 \sim C_8$  ハロアルコキシであり；

各  $R^{16}$  は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルキルまたは  $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルである、

実施形態 C の化合物。

#### 【0168】

実施形態 E .

$R^A$  および  $R^B$  は、これらが両方とも結合している窒素原子と一緒にあって炭素および酸素および  $-C(=O)-$  から選択される環員を含有する 5 もしくは 6 員環を形成しており；または、一緒にあって W - 1 ~ W - 13 からなる群から選択される 6 ~ 10 員二環式環系となっており（即ち、実施形態 15 に記載したように）；

$R^t$  は、ハロゲン、シアノまたは  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり；

r は、0 ~ 4 であり；

$Q^1$  は、 $R^{10}$  から独立して選択される 3 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；

$Q^2$  は、 $R^{11}$  から独立して選択される 3 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；

$R^2$  および  $R^3$  は、それぞれ独立して H であり；

10

20

30

40

50

$R^7$  および  $R^8$  は、それぞれ独立して H であり；  
 $R^9$  は、H、 $CH_3$  または  $-C(=O)OCH_3$  であり；  
 各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシまたは  $C_1 \sim C_8$  ハロアルコキシであり；  
 各  $R^{16}$  は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルキルまたは  $C_1 \sim C_6$  ハロアルキルである、実施形態 C の化合物。

## 【0169】

実施形態 F .

$R^A$  および  $R^B$  は、一緒になって W - 7、W - 8 および W - 9 から選択される 8 ~ 9 員二環式環系となっており；

$R^t$  は、ハロゲンまたは  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり；

r は、0 ~ 3 であり；

$Q^1$  は、 $R^{10}$  から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；

$Q^2$  は、 $R^{11}$  から独立して選択される 2 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；

$R^9$  は、H であり；

各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立してハロゲンまたは  $C_1 \sim C_8$  ハロアルキルである、実施形態 E の化合物。

## 【0170】

実施形態 G .

W は、 $-OR^C$  であり；

$R^C$  は、 $CF_3$ ；またはハロゲンで置換されているまたは非置換のフェニル；または非置換のピリジン環であり；

J は、 $-CR^2R^3-$  であり；

$Q^1$  は、 $R^{10}$  から独立して選択される 3 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；

$Q^2$  は、 $R^{11}$  から独立して選択される 3 個以下の置換基で置換されているまたは非置換のフェニル環であり；

$R^2$  および  $R^3$  は、それぞれ独立して H であり；

$R^9$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルコキシカルボニルであり；

$R^7$  および  $R^8$  は、それぞれ独立して H または F であり；

$R^9$  は、H、 $CH_3$  または  $-C(=O)OCH_3$  であり；

各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_1 \sim C_8$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシまたは  $C_1 \sim C_8$  ハロアルコキシである、実施形態 B の化合物。

## 【0171】

本発明の特定の実施形態は、発明の概要の以下の化合物である：

2 - [ ( 3 R , 4 S ) - 3 - [ [ ( 2 , 3 - ジフルオロフェニル ) アミノ ] カルボニル ] - 1 - メチル - 4 - [ 4 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] - 2 - ピロリジニリデン ] ヒドラジド 2 , 2 - ジメチルプロパン酸 ( 化合物 1 ) 。

## 【0172】

本発明は更に、本発明の化合物（例えば、本明細書に記載する組成物として）の除草有効量を植生の生息地に施用することを含む、望ましくない植生を防除する方法に関する。使用方法に関する実施形態として注目すべきは、上記実施形態の化合物が関与するものである。本発明の化合物は、コムギ、オオムギ、トウモロコシ、ダイズ、ヒマワリ、ワタ、ナタネおよびイネのような農作物、ならびにサトウキビ、柑橘類、果樹および堅果農作物のような特殊農作物における雑草の選択的な防除に特に有用である。

## 【0173】

上記実施形態の化合物を含む本発明の除草用組成物も、実施形態として注目に値する。

## 【 0 1 7 4 】

本発明は、(a)式1から選択される化合物、そのN-オキシドおよび塩と、(b)(b1)光化学系II阻害剤、(b2)アセトヒドロキシ酸シンターゼ(AHAS)阻害剤、(b3)アセチル-CoAカルボキシラーゼ(ACCase)阻害剤、(b4)オーキシン模倣体、(b5)5-エノール-ピルビルシキミ酸-3-リン酸(EPPS)シンターゼ阻害剤、(b6)光化学系I電子ダイバータ、(b7)プロトボルフィリノーゲンオキシダーゼ(PPO)阻害剤、(b8)グルタミンシンセターゼ(GS)阻害剤、(b9)超長鎖脂肪酸(VLCFA)エロンガーゼ阻害剤、(b10)オーキシン輸送阻害剤、(b11)フィトエンデサチュラーゼ(PDS)阻害剤、(b12)4-ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPD)阻害剤、(b13)ホモゲンチジン酸ソラネシルトランスフェラーゼ(HST)阻害剤、(b14)セルロース生合成阻害剤、(b15)有糸分裂攪乱物質、有機ヒ素剤、アシュラム、プロモブチド、シンメシリン、クミルロン、ダゾメット、ジフェンゾコート、ダイムロン、エトベンザニド、フルレノール、ホサミン、ホサミン-アンモニウム、ヒダントシジン、メタム、メチルダイムロン、オレイン酸、オキサジクロメフォン、ペラルゴン酸およびピリブチカルブを含む他の除草剤、および(b16)除草剤薬害軽減剤；ならびに(b1)~(b16)の化合物の塩から選択される少なくとも1種の追加の有効成分とを含む除草用混合物を更に含む。

10

## 【 0 1 7 5 】

「光化学系II阻害剤」(b1)は、Q<sub>B</sub>結合ニッチにおいてD-1タンパク質に結合し、それにより、葉緑体チラコイド膜におけるQ<sub>A</sub>からQ<sub>B</sub>への電子輸送をブロックする化合物である。光化学系IIを介した受け渡しブロックされた電子は、一連の反応を介して輸送されて毒性のある化合物を形成し、これが細胞膜を破壊して、葉緑体の膨潤、膜漏出を生じさせ、究極的には細胞破壊をもたらす。Q<sub>B</sub>結合ニッチは3つの異なる結合部位を有し：結合部位Aは、アトラジンのようなトリアジン、ヘキサジノンのようなトリアジノン、およびプロマシルのようなウラシルを結合させ、結合部位Bは、ジウロンのようなフェニル尿素を結合させ、結合部位Cは、ベンタゾンのようなベンゾチアジアゾール、プロモキシニルのようなニトリル、およびピリデートのようなフェニルピリダジンを結合させる。光化学系II阻害剤の例としては、アメトリン、アミカルバゾン、アトラジン、ベンタゾン、プロマシル、プロモフェノキシム、プロモキシニル、クロルプロムロン、クロリダゾン、クロロトルロン、クロロクスロン、クミルロン、シアナジン、ダイムロン、デスメディファム、デスメトリン、ジメフロム、ジメタメトリン、ジウロン、エチジムロン、フェヌロン、フルオメツロン、ヘキサジノン、アイオキシニル、イソプロツロン、イソウロン、レナシル、リニユロン、メタミトロン、メタベンズチアズロン、メトプロムロン、メトクスロン、メトリブジン、モノリニユロン、ネブロン、ペンタノクロール、フェンメディファム、プロメトン、プロメトリン、プロパニル、プロパジン、ピリダホル、ピリデート、シデュロン、シマジン、シメトリン、テブチウロン、ターバシル、テルブメトン、テルブチラジン、テルブトリンおよびトリエタジンが挙げられる。

20

30

## 【 0 1 7 6 】

「AHAS阻害剤」(b2)は、アセト乳酸シンターゼ(ALS)としても公知のアセトヒドロキシ酸シンターゼ(AHAS)を阻害し、それにより、タンパク質合成および細胞成長に必要なバリン、ロイシンおよびイソロイシンのような分枝鎖脂肪族アミノ酸の産生を阻害して植物を死滅させる化合物である。AHAS阻害剤の例としては、アミドスルフロン、アジムスルフロン、ベンスルフロン-メチル、ビスピリバク-ナトリウム、クロランスラム-メチル、クロリムロン-エチル、クロルスルフロン、シノスルフロン、シクロスルファミロン、ジクロスラム、エタメトスルフロン-メチル、エトキシスルフロン、フラザスルフロン、フロラスラム、フルカルバゾン-ナトリウム、フルメツラム、フルピルスルフロン-メチル、フルピルスルフロン-ナトリウム、ホラムスルフロン、ハロスルフロン-メチル、イマザメタベンゾ-メチル、イマザモキス、イマザピック、イマザピル、イマザキン、イマゼタピル、イマゾスルフロン、ヨードスルフロン-メチル(ナトリウム塩を含む)、イオフェンスルフロン(2-ヨード-N-[[(4-メトキシ-6-メチ

40

50

ル - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イル ) アミノ ] カルボニル ] ベンゼンスルホンアミド )、メソスルフロン - メチル、メタゾスルフロン ( 3 - クロロ - 4 - ( 5 , 6 - ジヒドロ - 5 - メチル - 1 , 4 , 2 - ジオキサジン - 3 - イル ) - N - [ [ ( 4 , 6 - ジメトキシ - 2 - ピリミジニル ) アミノ ] カルボニル ] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - スルホンアミド )、メトスラム、メトスルフロン - メチル、ニコスルフロン、オキサスルフロン、ペノキスラム、プリミスルフロン - メチル、プロボキシカルバゾン - ナトリウム、プロピリスルフロン ( 2 - クロロ - N - [ [ ( 4 , 6 - ジメトキシ - 2 - ピリミジニル ) アミノ ] カルボニル ] - 6 - プロピルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] ピリダジン - 3 - スルホンアミド )、プロスルフロン、ピラゾスルフロン - エチル、ピリベンゾオキシム、ピリフタリド、ピリミノバク - メチル、ピリチオバク - ナトリウム、リムスルフロン、スルホメツロン - メチル、スルホスルフロン、チエンカルバゾン、チフェンスルフロン - メチル、トリアファモン ( N - [ 2 - [ ( 4 , 6 - ジメトキシ - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イル ) カルボニル ] - 6 - フルオロフェニル ] - 1 , 1 - ジフルオロ - N - メチルメタンズルホンアミド )、トリアスルフロン、トリベヌロン - メチル、トリフロキシスルフロン ( ナトリウム塩を含む )、トリフルスルフロン - メチルおよびトリトスルフロンが挙げられる。  
【 0 1 7 7 】

10

「 A C C a s e 阻害剤 」 ( b 3 ) は、植物における脂質および脂肪酸合成の早期段階の触媒作用を担うアセチル - C o A カルボキシラーゼ酵素を阻害する化合物である。脂質は細胞膜の必須成分であり、脂質なしで新しい細胞を生成することはできない。アセチル C o A カルボキシラーゼの阻害と、その後の脂質産生の不足によって、とりわけ、分裂組織のような活発な成長領域における細胞膜の完全性が失われることとなる。最終的に、苗条および根茎の成長が止まり、苗条分裂組織および根茎芽の枝枯れが始まる。A C C a s e 阻害剤の例としては、アロキシジム、ブトロキシジム、クレトジム、クロジナホップ、シクロキシジム、シハロホップ、ジクロホップ、フェノキサプロップ、フルアジホップ、ハロキシホップ、ピノキサデン、プロホキシジム、プロパキサホップ、キサロホップ、セトキシジム、テブラロキシジムおよびトラルコキシジムが挙げられ、フェノキサプロップ - P、フルアジホップ - P、ハロキシホップ - P およびキサロホップ - P のような分割形態、ならびにクロジナホップ - プロパルギル、シハロホップ - ブチル、ジクロホップ - メチルおよびフェノキサプロップ - P - エチルのようなエステル形態が含まれる。

20

【 0 1 7 8 】

30

オーキシンは、多くの植物組織において成長を制御する植物ホルモンである。「オーキシン模倣体」( b 4 ) は、植物成長ホルモンであるオーキシンを模倣し、それにより、制御されない無秩序な成長を生じさせ、感受性種における植物死を生じさせる化合物である。オーキシン模倣体の例としては、アミノシクロピラクロル ( 6 - アミノ - 5 - クロロ - 2 - シクロプロピル - 4 - ピリミジンカルボン酸 ) とそのメチルエステルおよびエチルエステルならびにそのナトリウム塩およびカリウム塩、アミノピラリド、ベナゾリン - エチル、クロラムベン、クラシホス、クロメプロップ、クロピラリド、ジカンバ、2 , 4 - D、2 , 4 - D B、ジクロルプロップ、フルロキシピル、ハラウキシフェン ( 4 - アミノ - 3 - クロロ - 6 - ( 4 - クロロ - 2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル ) - 2 - ピリジンカルボン酸 )、ハラウキシフェン - メチル ( メチル 4 - アミノ - 3 - クロロ - 6 - ( 4 - クロロ - 2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル ) - 2 - ピリジンカルボキシラート )、M C P A、M C P B、メコプロップ、ピクロラム、キンクロラック、キンメラック、2 , 3 , 6 - T B A、トリクロピル、およびメチル 4 - アミノ - 3 - クロロ - 6 - ( 4 - クロロ - 2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル ) - 5 - フルオロ - 2 - ピリジンカルボキシラートが挙げられる。

40

【 0 1 7 9 】

「 E P S P シンターゼ阻害剤 」 ( b 5 ) は、チロシン、トリプトファンおよびフェニルアラニンのような芳香族アミノ酸の合成に関与する酵素である 5 - エノール - ピルビルシキミ酸 - 3 - リン酸シンターゼを阻害する化合物である。E P S P 阻害剤除草剤は、植物群葉を介して容易に吸収され、師部内を成長点へと移動する。グリホサートは、この群に

50

属する比較的非選択的な発生後処理除草剤である。グリホサートとしては、アンモニウム、イソプロピルアンモニウム、カリウム、ナトリウム（セスキナトリウムを含む）およびトリメシウム（代替名：スルホサート）などのエステルおよび塩が挙げられる。

#### 【0180】

「光化学系Ⅰ電子ダイバータ」（b6）は、光化学系Ⅰから電子を受け取り、数サイクル後にヒドロキシルラジカルを生成する化合物である。これらのラジカルは極めて反応性が高く、膜脂肪酸およびクロロフィルを含む不飽和脂質を容易に破壊する。これにより細胞膜の完全性が損なわれ、したがって、細胞および細胞小器官に「漏出」を生じさせ、葉が急速にしおれ、乾燥することとなり、最終的には植物死に至る。この第2のタイプの光合成阻害剤の例としては、ジクワットおよびパラコートが挙げられる。

10

#### 【0181】

「PPO阻害剤」（b7）は、酵素であるプロトポルフィリノーゲンオキシダーゼを阻害して、植物中において、細胞膜を破壊し細胞液を漏出させる反応性の高い化合物を急速に形成させる化合物である。PPO阻害剤の例としては、アシフルオルフェン・ナトリウム、アザフェニジン、ベンズフェンジゾン、ピフェノキス、ブタフェナシル、カルフェントラゾン、カルフェントラゾン・エチル、クロメトキシフェン、シニドン・エチル、シクロピラニル、フルアゾレート、フルフェンピル・エチル、フルミクロラク・ベンチル、フルミオキサジン、フルオログリコフェン・エチル、フルチアセト・メチル、ホメサフェン、ハロサフェン、ラクトフェン、オキサジアルギル、オキサジアゾン、オキシフルオルフェン、ペントキサゾン、プロフルアゾール、ピラクロニル、ピラフルフェン・エチル、サフルフェナシル、スルフェントラゾン、チジアジミン、トリフルジモキサジン（ジヒドロ - 1, 5 - ジメヒル - 6 - チオキソ - 3 - [ 2, 2, 7 - トリフルオロ - 3, 4 - ジヒドロ - 3 - オキソ - 4 - ( 2 - プロピン - 1 - イル ) - 2 H - 1, 4 - ベンゾオキサジン - 6 - イル ] - 1, 3, 5 - トリアジン - 2, 4 ( 1 H, 3 H ) - ジオン）およびチアフェナシル（メチル N - [ 2 - [ [ 2 - クロロ - 5 - [ 3, 6 - ジヒドロ - 3 - メチル - 2, 6 - ジオキソ - 4 - ( トリフルオロメチル ) - 1 ( 2 H ) - ピリミジニル ] - 4 - フルオロフェニル ] チオ ] - 1 - オキソプロピル ] - アラニネート）が挙げられる。

20

#### 【0182】

「GS阻害剤」（b8）は、植物がアンモニアのグルタミンへの転換に用いるグルタミンシンセターゼ酵素の活性を阻害する化合物である。したがって、アンモニアが蓄積し、グルタミンレベルが低下する。植物損傷は、おそらく、アンモニアの毒性と他の代謝プロセスに必要なアミノ酸の欠乏との複合効果により生じる。GS阻害剤としては、グルホシネートと、グルホシネート・アンモニウムおよび他のホスフィノトリシン誘導体、グルホシネート・P（（2S）-2-アミノ-4-（ヒドロキシメチルホスフィニル）ブタン酸）およびピラナホスのようなそのエステルおよび塩が挙げられる。

30

#### 【0183】

「VLCAエロンガーゼ阻害剤」（b9）は、エロンガーゼを阻害する多種多様な化学構造を有する除草剤である。エロンガーゼは、VLCAの生合成に参与する、葉緑体中またはその付近に存在する酵素の1種である。植物中で、超長鎖脂肪酸は、葉面における乾燥を防止し、花粉粒に安定性をもたらす疎水性ポリマーの主要構成成分である。このような除草剤としては、アセトクロール、アラクロール、アニロホス、ブタクロール、カフェンストロール、ジメタクロール、ジメテナミド、ジフェナミド、フェノキサスルホン（3 - [ [ ( 2, 5 - ジクロロ - 4 - エトキシフェニル ) メチル ] スルホニル ] - 4, 5 - ジヒドロ - 5, 5 - ジメチルイソオキサゾール）、フェントラザミド、フルフェナセット、インダノファン、メフェナセット、メタザクロール、メトラクロール、ナプロアニリド、ナプロパミド、ナプロパミド・M（（2R）-N, N - ジエチル - 2 - ( 1 - ナフタレニルオキシ ) プロパンアミド）、ペトキサミド、ピペロホス、プレチラクロール、プロバクロール、プロピソクロール、ピロキサスルホン、およびテニルクロールが挙げられ、Sメトラクロール、クロロアセタミドおよびオキシアセタミドのような分割形態が含まれる。

40

50

## 【 0 1 8 4 】

「オーキシン輸送阻害剤」(b 1 0)は、オーキシン担体タンパク質と結合することなどにより植物中のオーキシン輸送を阻害する化学物質である。オーキシン輸送阻害剤の例としては、ジフルフェンゾピル、ナプタラム(N - (1 - ナフチル) - フタルアミド酸および2 - [(1 - ナフタレニルアミノ)カルボニル]安息香酸としても公知である)が挙げられる。

## 【 0 1 8 5 】

「PDS阻害剤」(b 1 1)は、フィトエンデサチュラーゼ工程におけるカロテノイド生合成経路を阻害する化合物である。PDS阻害剤の例としては、ペフルプタミド、S - ペフルプタミド、ジフルフェニカン、フルリドン、フルクロリドン、フルルタモンノルフルルゾンおよびピコリナフェンが挙げられる。

10

## 【 0 1 8 6 】

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

20

30

## 【 0 1 8 7 】

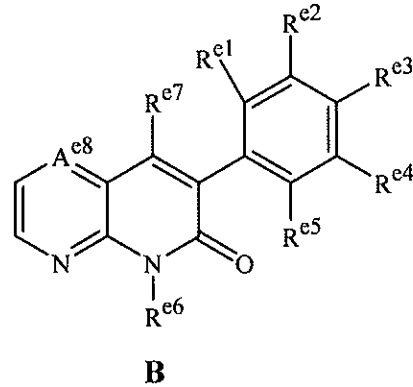
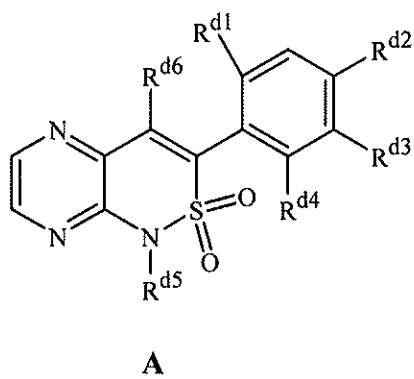
HST阻害剤(b 1 3)は、ホモゲンチジン酸を2 - メチル - 6 - ソラニル - 1 , 4 - ベンゾキノンに変換する植物の能力を攪乱し、それにより、カロテノイド生合成を攪乱する。HST阻害剤の例としては、ハロキシジン、ピリクロル、3 - (2 - クロロ - 3 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 1 , 5 - ナフチリジン - 2 (1 H) - オン、7 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 5 - (2 , 2 - ジフルオロエチル) - 8 - ヒドロキシピリド[2 , 3 - b]ピラジン - 6 (5 H) - オンおよび4 - (2 , 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノンが挙げられる。

40

## 【 0 1 8 8 】

HST阻害剤としては更に、式AおよびBの化合物が挙げられる。

## 【化 1 2】



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

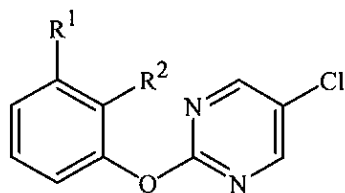
## 【0189】

「セルロース生合成阻害剤」(b14)は、特定の植物におけるセルロースの生合成を阻害する。若い植物または急速に成長する植物に対して発生前または発生後早期に施用した場合に最も効果的である。セルロース生合成阻害剤の例としては、クロルチアミド、ジクロベニル、フルボキサム、インダジフラム( $N^2 - [(1R, 2S) - 2, 3 - ジヒドロ - 2, 6 - ジメチル - 1H - インデン - 1 - イル] - 6 - (1 - フルオロエチル) - 1, 3, 5 - トリアジン - 2, 4 - ジアミン$ )、イソキサベンおよびトリアジフラムが挙げられる。

## 【0190】

「他の除草剤」(b15)は、有糸分裂攪乱物質(例えば、フラムプロップ-M-メチルおよびフラムプロップ-M-イソプロピル)、有機ヒ素(例えば、DSMA、およびMSMA)、7, 8 - ジヒドロプテロイン酸シンターゼ阻害剤、葉緑体イソプレノイド合成阻害剤および細胞壁生合成阻害剤のような、多様に異なる作用形態を介して作用する除草剤を含む。他の除草剤は、未知の作用形態を有するか、または、(b1) ~ (b14)に列挙した特定のカテゴリに属さないか、または、上記に列挙した作用形態の組合せを介して作用する除草剤を含む。他の除草剤の例としては、アクロニフェン、アスラム、アミトロール、プロモブチド、シンメチリン、クロマゾン、クミルウロン、シクロピリモレート(6 - クロロ - 3 - ((2 - シクロプロピル - 6 - メチルフェノキシ) - 4 - ピリダジニル 4 - モルホリンカルボキシレート)、ダイムロン、2 - [(2, 5 - ジクロロフェニル)メチル] - 4, 4 - ジメチル - 3 - イソオキサゾリジノン、ジフェンゾクアット、エトベンザニド、フルオメツロン、フルレノール、ホサミン、ホサミン - アンモニウム、ダゾメット、ジムロン、イプフェンカルバゾン(1 - ((2, 4 - ジクロロフェニル) - N - ((2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 5 - ジヒドロ - N - ((1 - メチルエチル) - 5 - オキソ - 4H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 4 - カルボキサミド)、メタム、メチルジムロン、オレイン酸、オキサジクロメホン、ペラルゴン酸、ピリブチカルブおよび5 - [[(2, 6 - ジフルオロフェニル)メトキシ]メチル] - 4, 5 - ジヒドロ - 5 - メチル - 3 - ((3 - メチル - 2 - チエニル)イソオキサゾールが挙げられる。「他の除草剤」(b15)には、式(b15A)の化合物も含まれる

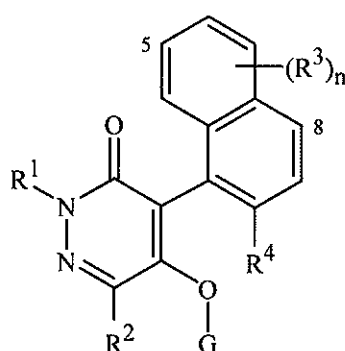
## 【化 1 3】



(b15A)

(式中、 $R^1$ は、Cl、BrまたはCNであり； $R^2$ は、 $C(=O)CH_2CH_2CF_3$ 、 $CH_2CH_2CH_2CH_2CF_3$ または3- $CHF_2$ -イソオキサゾール-5-イルである)。「他の除草剤」(b15)には、式(b15B)の化合物も含まれる

## 【化 1 4】



(b15B)

(式中、 $R^1$ は、 $CH_3$ であり、 $R^2$ は、Meであり、 $R^4$ は、 $OCHF_2$ であり、Gは、Hであり、nは、0である； $R^1$ は、 $CH_3$ であり、 $R^2$ は、Meであり、 $R^3$ は、5-Fであり、 $R^4$ は、Clであり、Gは、Hであり、nは、1である； $R^1$ は、 $CH_3$ であり、 $R^2$ は、Clであり、 $R^4$ は、Meであり、Gは、Hであり、nは、0である； $R^1$ は、 $CH_3$ であり、 $R^2$ は、Meであり、 $R^3$ は、5-Meであり、 $R^4$ は、 $OCHF_2$ であり、Gは、Hであり、nは、1である； $R^1$ は、 $CH_3$ であり、 $R^2$ は、Meであり、 $R^3$ は、5-Brであり、 $R^4$ は、 $OCHF_2$ であり、Gは、Hであり、nは、1である； $R^1$ は、 $CH_3$ であり、 $R^2$ は、Meであり、 $R^3$ は、5-Clであり、 $R^4$ は、Clであり、Gは、Hであり、nは、1である；または、 $R^1$ は、 $CH_3$ であり、 $R^2$ は、 $CH_3$ であり、 $R^4$ は、 $OCHF_2$ であり、Gは、 $C(O)Me$ であり、nは、0である)。

## 【0191】

「他の除草剤」(b15)には、式(b15C)の化合物も含まれる

10

20

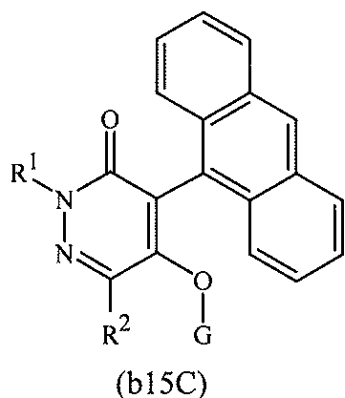
30

40

50



## 【化 15】



10

(式中、

R<sup>1</sup>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sup>2</sup>は、Clであり、Gは、Hである；またはR<sup>1</sup>は、CH<sub>3</sub>であり、R<sup>2</sup>は、Clであり、Gは、C(O)Meである)。

## 【0192】

「除草剤薬害軽減剤」(b16)は、特定の農作物に対する除草剤の植物毒性効果を排除または低減するために、除草剤製剤に添加される物質である。これらの化合物は、除草剤による被害から農作物を保護するが、典型的には、除草剤による望ましくない植生の防除を妨げないものである。除草剤薬害軽減剤の例としては、ベノキサコール、クロキントセト・メキシル、クミルウロン、シオメトリニル、シプロスルファミド、ダイムロン、ジクロロミド、ジシクロノン、ジエトレート、ジメピペレート、フェンクロラゾール・エチル、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン・エチル、メフェンピル・ジエチル、メフェネート、メトキシフェノン、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、N-(アミノカルボニル)-2-メチルベンゼンスルホンアミドおよびN-(アミノカルボニル)-2-フルオロベンゼンスルホンアミド、1-プロモ-4-[(クロロメチル)スルホニル]ベンゼン、2-(ジクロロメチル)-2-メチル-1,3-ジオキサラン(MG 191)、4-(ジクロロアセチル)-1-オキサ-4-アゾスピロ[4.5]デカン(MON 4660)、2,2-ジクロロ-1-(2,2,5-トリメチル-3-オキサゾリジニル)-エタノンおよび2-メトキシ-N-[[4-[(メチルアミノ)カルボニル]アミノ]フェニル]スルホニル]-ベンズアミドが挙げられるが、これらに限定されない。

20

30

## 【0193】

式1の化合物は、有機合成化学の技術分野で公知の一般的な方法によって製造可能である。注目すべきは、スキーム1~Xに記載の下記の方法およびそれらの変形である。以下の式1~9の化合物におけるW、R<sup>1</sup>、J、Q<sup>1</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、Q<sup>2</sup>およびYの定義は、特に断りのない限り、発明の概要において上記に定義されている通りである。式1A~1Cおよび2Aは、それぞれ式1および2の化合物の様々な部分集合である。各部分集合の式に係る置換基は、特に断りのない限りその親式に関して上記に定義されている通りである。

40

## 【0194】

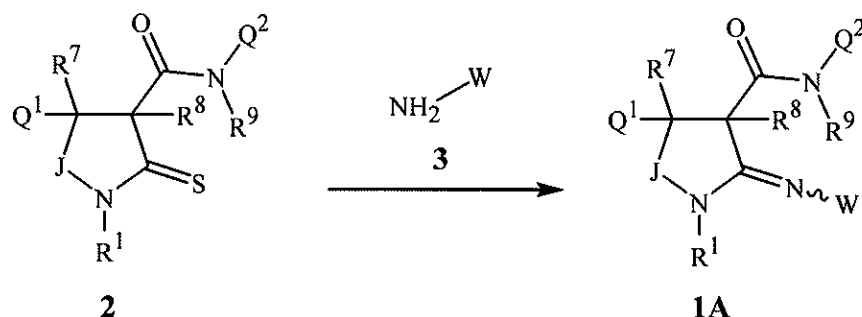
スキーム1に示すように、式1Aの化合物(即ち、YがOである式1の化合物)は、式2のチオラクタムと式3のアミンとの反応によって製造することができる。これらの反応は、ルイスまたはブレンステッド酸のような活性化剤の添加によって促進することができ、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、アセトニトリル、ジクロロメタンまたはN,N-ジメチルホルムアミドのような溶媒中、0~120℃の範囲の温度で典型的には行われる。酢酸第二水銀を利用したスキーム1の方法が、合成例2の工程Aにより例示される。

50

【 0 1 9 5 】

【 化 1 6 】

## スキーム 1



10

【 0 1 9 6 】

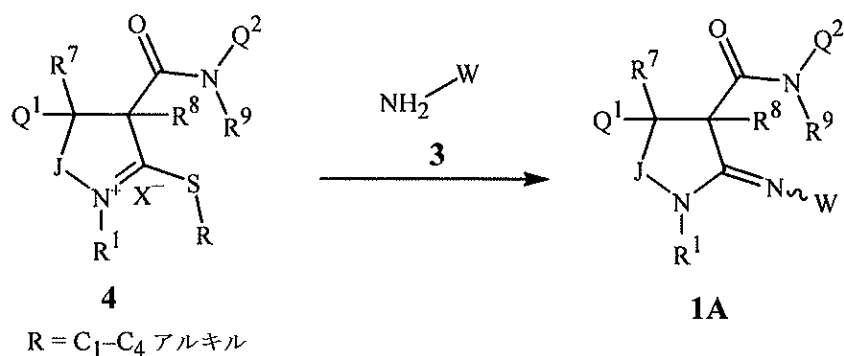
スキーム 2 に示すように、式 1 A の化合物は、別法として式 4 のチオアルキルイミダートと式 3 のアミンとの反応によって製造することができる。これらの反応は、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、アセトニトリル、ジクロロメタンまたは N , N - ジメチルホルムアミドのような溶媒中、0 ~ 120 の範囲の温度で典型的には行われる。

20

【 0 1 9 7 】

【 化 1 7 】

## スキーム 2



30

【 0 1 9 8 】

スキーム 3 に示すように、式 4 の化合物は、式 2 のチオラクタムとアルキル化剤との反応によって製造することができる。適切なアルキル化剤としては、スルホン酸アルキル、またはヨウ化メチルもしくは臭化メチルのようなハロゲン化アルキルが挙げられるが、これに限定されない。これらの反応は、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、ジクロロメタンまたは N , N - ジメチルホルムアミドのような溶媒中、0 ~ 80 の範囲の反応温度で典型的には行われる。

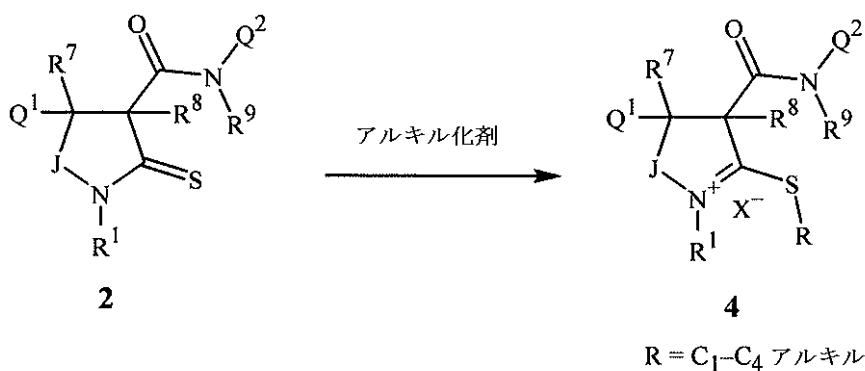
40

【 0 1 9 9 】

50

【化 1 8】

スキーム 3



10

【0200】

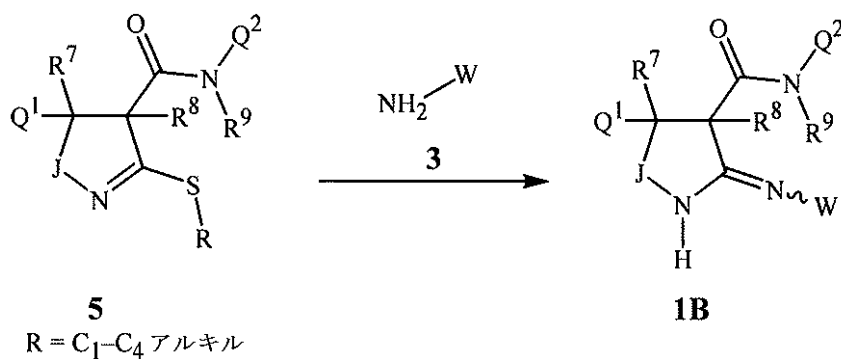
スキーム 4 に示すように、式 1 B の化合物（即ち、Y が O であり、R<sup>1</sup> が H である式 1）は、式 5 のチオアルキルイミダートと式 3 のアミンとの反応によって製造することができる。これらの反応は、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、アセトニトリル、ジクロロメタンまたは N, N - ジメチルホルムアミドのような溶媒中、0 ~ 120 の

20

【0201】

【化 1 9】

スキーム 4



30

【0202】

スキーム 5 に示すように、式 5 の化合物は、式 2 A のチオラクタム（即ち、R<sup>1</sup> が H である式 2 の化合物）とアルキル化剤との反応によって製造することができる。適切なアルキル化剤としては、スルホン酸アルキル、またはヨウ化メチルもしくは臭化メチルのようなハロゲン化アルキルが挙げられるが、これに限定されない。これらの反応は、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、ジクロロメタンまたは N, N - ジメチルホルムアミドのような溶媒中、トリエチルアミンまたは炭酸カリウムなどであるが、これに限定されない塩基の存在下で 0 ~ 80 の範囲の反応温度で典型的には行われる。

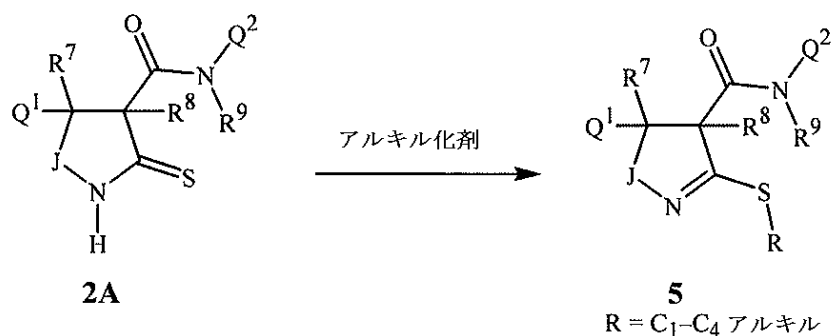
40

【0203】

50

## 【化 2 0】

スキーム 5



10

## 【0 2 0 4】

スキーム 6 に示すように、式 2 の化合物は、プロピルホスホン酸無水物、ジシクロヘキシルカルボジイミド、N - ( 3 - ジメチルアミノプロピル ) - N ' - エチルカルボジイミド、N , N ' - カルボニルジイミダゾール、2 - クロロ - 1 , 3 - ジメチルイミダゾリウムクロリド、または 2 - クロロ - 1 - メチルピリジニウムヨードのような脱水性カップリング試薬の存在下での式 6 の酸と式 7 のアミンとの反応によって製造することができる。ポリマー担持シクロヘキシルカルボジイミドのようなポリマー担持試薬も、適している。これらの反応は、ジクロロメタン、アセトニトリル、N , N - ジメチルホルムアミドまたは酢酸エチルのような溶媒中において、トリエチルアミン、N , N - ジイソプロピルアミン、または 1 , 8 - ジアザビシクロ [ 5 . 4 . 0 ] ウンデカ - 7 - エンのような塩基の存在下で、0 ~ 60 の範囲の温度で典型的には行われる。プロピルホスホン酸無水物を採用したカップリング条件については、Organic Process Research & Development 2009、13、900 ~ 906 頁を参照されたい。プロピルホスホン酸無水物を利用するスキーム 6 の方法は、合成例 1 の工程 H により例示される。式 2 の化合物にある環の 2 および 3 位の置換基、即ち、C ( O ) N ( Q<sup>2</sup> ) ( R<sup>9</sup> ) は、主にトランス配置にある。場合によっては、少量のシス異性体の存在が NMR によって検出される可能性がある。

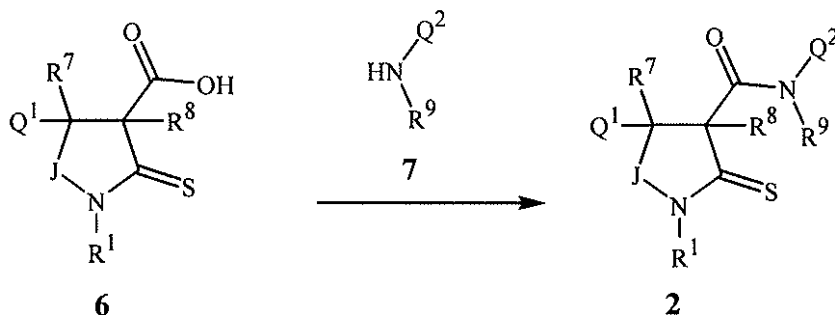
20

30

## 【0 2 0 5】

## 【化 2 1】

スキーム 6



40

## 【0 2 0 6】

スキーム 7 に示すように、式 6 の化合物は、当業者には周知の方法による、式 8 のエステルの加水分解によって製造することができる。加水分解は、水性塩基または水性酸を用い、典型的には共溶媒の存在下で実施される。反応に適する塩基としては、水酸化ナトリウムおよびカリウムのような水酸化物、ならびに炭酸ナトリウムおよびカリウムのような

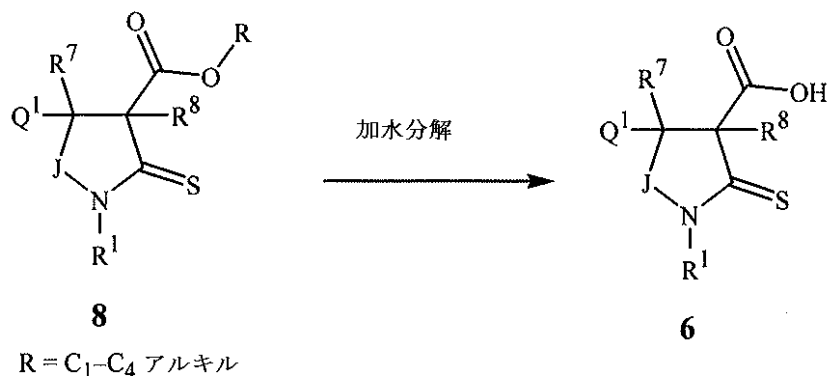
50

炭素塩が挙げられるが、これに限定されない。反応に適する酸としては、塩酸、臭化水素酸および硫酸のような無機酸、ならびに酢酸およびトリフルオロ酢酸のような有機酸が挙げられるが、これに限定されない。メタノール、エタノールおよびテトラヒドロフランを含むがこれに限定されない多種多様な共溶媒が反応に適している。反応は、 $-20$  から溶媒の沸点まで、典型的には  $0 \sim 100$  の範囲の温度で行われる。スキーム 7 の方法は、合成例 1 の工程 C により例示される。

【0207】

【化22】

スキーム 7



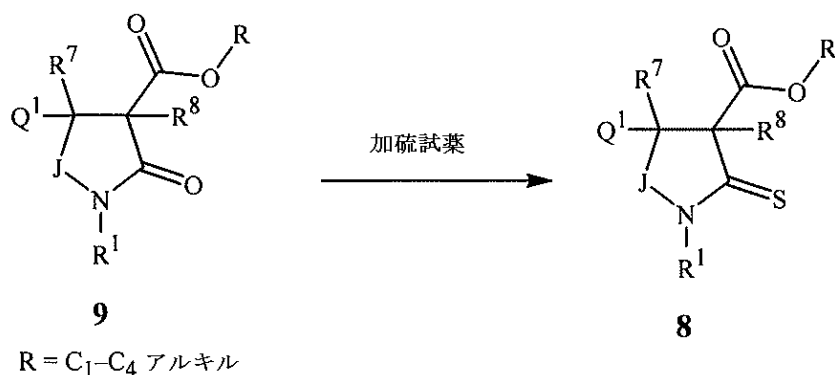
【0208】

スキーム 8 に示すように、式 8 の化合物は、テトラヒドロフランまたはトルエンのような溶媒中、式 9 の化合物をローソン試薬、十硫化四リンまたは五硫化二リンのような加硫試薬と反応させることによって製造することができる。典型的には、反応は、 $0 \sim 115$  の範囲の温度で行われる。ローソン試薬を利用したスキーム 8 の方法が、合成例 1 の工程 F により例示される。

【0209】

【化23】

スキーム 8



【0210】

式 9 の化合物は文献において公知であり、以下を参照されたい：特許文献 3。

【0211】

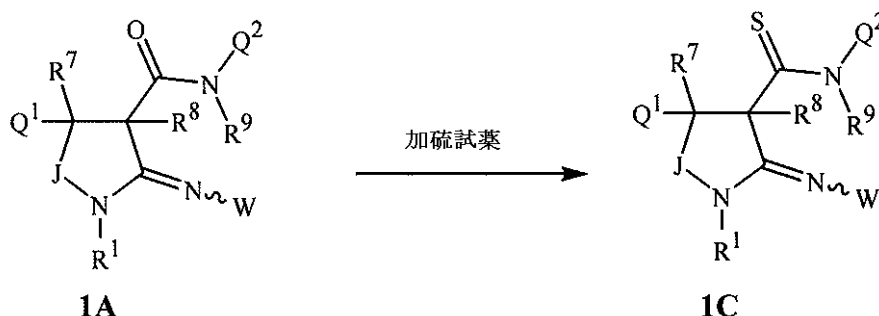
スキーム 9 に示すように、式 1 C の化合物（即ち、Y が S である式 1）は、テトラヒドロフランまたはトルエンのような溶媒中、式 1 A の化合物をローソン試薬、十硫化四リンまたは五硫化二リンのような加硫試薬と反応させることによって製造することができる。

典型的には、反応は、0 ~ 115 の範囲の温度で行われる。

【0212】

【化24】

スキーム9



10

【0213】

当業者であれば認識することであるが、様々な官能基を他の官能基に変換して異なる式1の化合物を得ることが可能である。官能基の相互変換を単純にわかりやすく例示している貴重な資料としては、Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations、第2版、Wiley-VCH、New York、1999を参照されたい。例えば、式1の化合物の製造のための中間体は、芳香族ニトロ基を含有していてもよく、これをアミノ基に還元し、次いで、ザンドマイヤー反応のような当技術分野で周知の反応を介して様々なハロゲン化物に変換して式1の化合物をもたらすことが可能である。上記の反応はまた、多くの事例において、代替的な順序で実行可能である。

20

【0214】

式1の化合物の製造について上述した試薬および反応条件の一部は、中間体に存在する特定の官能基には適合しない可能性があることが認識されている。そうした事例においては、保護/脱保護手順または官能基相互変換を合成に組み込むことが、所望の生成物の入手に役立つ。保護基の使用および選択は、化学合成における当業者には明らかである（例えば、Greene, T.W.; Wuts, P.G.M. Protective Groups in Organic Synthesis、第2版; Wiley: New York、1991を参照されたい）。当業者であれば認識することであるが、場合によっては、式1の化合物の合成を完了させるために、個々のスキームのいずれかにおいて示されているような所与の試薬を導入した後、詳細には記載されていない追加の慣例的な合成工程を実施する必要がある場合がある。当業者であれば更に認識することであるが、上記のスキームに例示されている工程の組合せを、式1の化合物を製造するために特に示唆されている順序以外の順序で実施する必要がある場合がある。

30

【0215】

当業者であれば更に認識することであるが、本明細書に記載の式1の化合物および中間体は、置換基を付加するために、または、既存の置換基を修飾するために、様々な求電子性反応、求核性反応、ラジカル反応、有機金属反応、酸化反応および還元反応に供することが可能である。

40

【0216】

更なる詳細がなくても、先行する記載を使用する当業者は、本発明を最大限に利用可能であると考えられる。したがって、以下の実施例は、単なる例示に過ぎず、決して本開示を限定するものではないと解釈すべきである。以下の実施例における工程は、合成変換全体における各工程のための手法を例示するものであり、各工程のための出発材料は、必ずしも、手法が他の実施例または工程において記載されている特定の製造実験によって製造されていなくてもよい。パーセンテージは、クロマトグラフ溶媒混合物の場合、または、

50

他に記載のある場合を除き、重量基準である。クロマトグラフ溶媒混合物に対する部およびパーセンテージは、別段の指示がない限り体積基準である。 $^1\text{H}$  NMRスペクトルは、特に断りのない限り400 MHzにおける $\text{CDCl}_3$ 中のテトラメチルシランからの低磁場側のppmで報告されており、「s」は一重項を意味し、「d」は二重項を意味し、「t」は三重項を意味し、「q」は四重項を意味し、「m」は多重項を意味し、「bs」は広幅一重項を意味する。

#### 【0217】

##### 合成例1

(3R, 4S) - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 2 - ヒドラジニリデン - 1 - メチル - 4 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 3 - ピロリジンカルボキサミド (化合物2) の製造

10

工程A: 1, 3ジエチル2 - [(1S) - 2 - ニトロ - 1 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]エチル] - プロパンジオアートの製造

1 - [(1E) - 2 - ニトロエチル] - 4 - (トリフルオロメチル)ベンゼン(14 g、64.5 mmol)のトルエン(70 mL)溶液に、マロン酸ジエチル(12.38 g、77.4 mmol)とビス[(1R, 2R) - N<sup>1</sup>, N<sup>2</sup> - ビス(フェニルメチル) - 1, 2 - シクロヘキサジアミン - N<sup>1</sup>, N<sup>2</sup>]ジプロモニックル(OC - 6 - 12)(CAS登録番号941321 - 23 - 9)(1.03 g、1.29 mmol)を添加した。反応混合物を室温で48時間撹拌した。次いで、反応混合物を真空中で濃縮して粗成生物を得、これをシリカに充填し、中圧液体クロマトグラフィー(溶離剤として石油エーテル中10%酢酸エチル)により精製して表題化合物25 gを得た。

20

#### 【0218】

工程B: エチル(3R, 4S) - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 3 - ピロリジンカルボキシラートの製造

1, 3 - ジエチル2 - [(1S) - 2 - ニトロ - 1 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]エチル] - プロパンジオアート(即ち、工程Aの生成物)(25 g、66.31 mmol)のエタノール(250 mL)と水(38 mL)の溶液に、鉄粉末(18.56 g、331.56 mmol)と塩化アンモニウム(1.79 g、33.15 mmol)を添加し、反応混合物を100 で加熱した。16時間後、反応混合物をCelite(登録商標)ケイ藻土ろ過剤を通してろ過し、真空中で濃縮した。残留物を水で希釈し、酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機層を水と塩水で洗浄し、 $\text{Na}_2\text{SO}_4$ 上で乾燥させた。溶媒を真空中で濃縮して粗化合物を得、これをn - ペンタンで洗浄して125 ~ 129 で溶融する表題化合物10.6 gを得た。

30

#### 【0219】

工程C: (3R, 4S) - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 3 - ピロリジンカルボン酸の製造

エチル(3R, 4S) - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 3 - ピロリジンカルボキシレート(即ち、工程Bの生成物)(9.6 g、31.89 mmol)のエタノール(100 mL)と水(100 mL)の溶液に、水酸化ナトリウム(3.82 g、95.68 mmol)を0 で添加した。反応混合物を室温で16時間撹拌し、その後反応混合物を真空中で濃縮し、固体を水に溶解させた。水層を0 で6 NのHClでpH1に酸性化し、結果として得られた固体をろ過によって集め、真空中で乾燥させて、120 ~ 122 で溶融するオフホワイト色の固体としての表題化合物8.2 g(収率94%)を得た。

40

#### 【0220】

工程D: (3R, 4S) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 3 - ピロリジンカルボン酸の製造

テトラヒドロフラン(5 mL)中の(3R, 4S) - 2 - オキソ - 4 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 3 - ピロリジンカルボン酸(即ち、工程Cの生成物)(5 g、18.31 mmol)を、カリウムt - ブトキシド(テトラヒドロフラン中1 N、54

50

． 9 m L、 5 4 . 9 m m o l ) に 0 でゆっくりと添加した。 1 0 分後、プロモメタン (トルエン中 2 5 %、 1 7 . 3 9 m L、 4 5 . 7 8 m m o l ) を添加し、反応混合物を室温で攪拌した。 1 2 時間後、反応混合物を酢酸エチルで希釈し、 0 で 1 N の H C l で p H 1 に酸性化した。結果として得られた固体をろ過によって集め、真空下で乾燥させた。粗固体を n - ペンタンで洗浄して、 1 4 3 ~ 1 4 7 で溶融するオフホワイト色の固体としての表題化合物 4 . 6 g を得た。

$^1\text{H NMR}$  (dmso  $d_6$ ) 12.8 (bs, 1H), 7.73-7.71 (d, 2H), 7.59-7.57 (d, 2H), 3.94-3.89 (m, 1H), 3.77-3.72 (t, 1H), 3.61-3.58 (d, 1H), 3.41-3.26 (m, 1H), 2.80 (s, 3H).

#### 【 0 2 2 1 】

工程 E : メチル ( 3 R , 4 S ) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [ 4 - (トリフルオロメチル) フェニル ] - 3 - ピロリジンカルボキシラートの製造

( 3 R , 4 S ) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [ 4 - (トリフルオロメチル) フェニル ] - 3 - ピロリジンカルボン酸 (即ち、工程 D の生成物) ( 2 . 5 g、 8 . 7 1 m m o l ) のメタノール ( 3 0 m L ) 溶液に硫酸 ( 2 . 5 m L ) を添加し、反応混合物を 9 0 で加熱した。 1 6 時間後、反応混合物を真空中で濃縮し、水で希釈した。水層を酢酸エチルで 2 回抽出し、合わせた有機物を水と塩水で洗浄し、  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  上で乾燥させた。溶媒を除去し、結果として得られた固体を n - ペンタンで洗浄して、 8 9 ~ 9 1 で溶融するオフホワイト色の固体としての表題化合物 2 . 2 5 g を得た。

$^1\text{H NMR}$  7.62-7.60 (d, 2H), 7.36-7.34 (d, 2H), 4.07-4.06 (d, 1H), 3.85-3.80 (m, 1H), 3.78 (s, 3H), 3.59-3.56 (d, 1H), 3.44-3.39 (m, 1H), 2.95 (s, 3H).

#### 【 0 2 2 2 】

工程 F : メチル ( 3 S , 4 S ) - 1 - メチル - 2 - チオキソ - 4 - [ 4 - (トリフルオロメチル) フェニル ] - 3 - ピロリジンカルボキシラートの製造

メチル ( 3 R , 4 S ) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - [ 4 - (トリフルオロメチル) フェニル ] - 3 - ピロリジンカルボキシレート (即ち、工程 E の生成物) ( 2 g、 6 . 6 4 m m o l ) のトルエン ( 4 0 m L ) 溶液にローソン試薬 ( 3 . 2 2 g、 7 . 9 m m o l ) を添加し、反応混合物を 1 2 5 で攪拌した。 3 時間後、反応混合物を水で希釈し、酢酸エチル ( 3 x ) で抽出した。合わせた有機層を水と塩水で洗浄し、  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  上で乾燥させた。次いで、有機物を減圧下で濃縮して粗物質を得、これを石油中 1 5 % 酢酸エチルで溶出するシリカゲルクロマトグラフィーによって精製して、 1 5 2 ~ 1 5 6 で溶融する固体としての表題化合物 2 g を得た。

$^1\text{H NMR}$  7.62-7.60 (d, 2H), 7.33-7.31 (d, 2H), 4.26-4.21 (m, 1H), 4.07-4.02 (m, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.78-3.75 (m, 1H), 3.34 (s, 3H).

#### 【 0 2 2 3 】

工程 G : ( 3 S , 4 S ) - 1 - メチル - 2 - チオキソ - 4 - [ 4 - (トリフルオロメチル) フェニル ] - 3 - ピロリジンカルボン酸の製造

メチル ( 3 S , 4 S ) - 1 - メチル - 2 - チオキソ - 4 - [ 4 - (トリフルオロメチル) フェニル ] - 3 - ピロリジンカルボキシレート (即ち、工程 F の生成物) ( 0 . 6 g、 1 . 8 9 m m o l ) のエタノール ( 2 0 m L ) と  $\text{H}_2\text{O}$  ( 2 0 m L ) の溶液に、水酸化ナトリウム ( 0 . 2 3 g、 5 . 6 8 m m o l ) を 0 で添加した。反応混合物を室温で 1 6 時間攪拌した。次いで、反応混合物を真空中で濃縮し、結果として得られた固体を水に溶解させた。水性混合物を 0 で 6 N の塩酸で p H 1 に酸性化した。結果として得られた固体をろ過によって集め、真空下で乾燥させて、 1 0 4 ~ 1 0 8 で溶融する固体としての表題化合物 0 . 5 7 g を得た。

$^1\text{H NMR}$  (dmso  $d_6$ ) 12.85 (bs, 1H), 7.74-7.72 (d, 2H), 7.57-7.55 (d, 2H), 4.21-4.17 (m, 1H), 4.02-3.95 (m, 1H), 3.90-3.78 (m, 2H), 3.23 (s, 3H).

#### 【 0 2 2 4 】

工程 H : ( 3 S , 4 S ) - N - ( 2 , 3 - ジフルオロフェニル ) - 1 - メチル - 2 - チオキソ - 4 - [ 4 - (トリフルオロメチル) フェニル ] - 3 - ピロリジンカルボキサミドの



## 製造

(3S, 4S) - 1 - メチル - 2 - チオキソ - 4 - [ 4 - (トリフルオロメチル) フェニル ] - 3 - ピロリジンカルボン酸 (即ち、工程 G の生成物) (0.5 g、1.65 mmol) の N, N - ジメチルホルムアミド (5 mL) とジクロロメタン (40 mL) の溶液に、トリエチルアミン (0.71 mL、4.95 mmol) と 2, 3 - ジフルオロアニリン (0.42 g、3.30 mmol) を添加した。反応混合物を室温で 10 分間攪拌し、次いで、プロピルホスホン酸無水物 (T3P (登録商標)) (酢酸エチル中 50%、2.25 mL、3.30 mmol) を 0 で添加した。室温で 12 時間攪拌した後、反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで 3 回抽出した。合わせた有機層を水と塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 上で乾燥させた。次いで、有機層を減圧下で濃縮して粗物質を得、これを石油エーテル中 20% 酢酸エチルで溶出するシリカゲルクロマトグラフィーによって精製して、183 ~ 187 で溶融するオフホワイト色の固体としての表題化合物 0.32 を得た。<sup>1</sup>H NMR 10.05 (bs, 1H), 7.98-7.95 (t, 1H), 7.63-7.40 (d, 2H), 7.40-7.26 (d, 2H), 7.06-6.99 (m, 1H), 6.94-6.87 (m, 1H), 4.48-4.43 (m, 1H), 4.28-4.23 (m, 1H), 4.04-4.03 (d, 1H), 3.77-3.73 (q, 1H), 3.36 (s, 3H).

## 【0225】

工程 I : (3R, 4S) - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 2 - ヒドラジニリデン - 1 - メチル - 4 - [ 4 - (トリフルオロメチル) フェニル ] - 3 - ピロリジンカルボキサミドの製造

(3S, 4S) - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 1 - メチル - 2 - チオキソ - 4 - [ 4 - (トリフルオロメチル) フェニル ] - 3 - ピロリジンカルボキサミド (即ち、工程 H の生成物) (0.2 g、0.48 mmol) のメタノール (10 mL) 溶液にヒドラジン水和物 (2.0 mL) を添加し、反応混合物を室温で攪拌した。48 時間後、反応混合物を減圧下で濃縮し、結果として得られた固体を n - ペンタンで洗浄して、120 ~ 123 で溶融する固体としての表題化合物 80 mg を得た。<sup>1</sup>H NMR 12.09 (s, 1H), 8.10-8.07 (m, 1H), 7.61-7.58 (d, 2H), 7.32-7.30 (d, 2H), 7.07-6.99 (m, 1H), 6.90-6.84 (m, 1H), 6.17 (bs, 2H), 4.34-4.33 (d, 1H), 4.16 (s, 1H), 4.03-3.99 (m, 1H), 3.32-3.30 (d, 1H), 2.93 (s, 3H).

## 【0226】

## 合成例 2

2 - [ (3R, 4S) - 3 - [ [ (2, 3 - ジフルオロフェニル) アミノ ] カルボニル ] - 1 - メチル - 4 - [ 4 - (トリフルオロメチル) フェニル ] - 2 - ピロリジニリデン ] ヒドラジド 2, 2 - ジメチルプロパン酸 (化合物 1) の製造

工程 A : 2 - [ (3R, 4S) - 3 - [ [ (2, 3 - ジフルオロフェニル) アミノ ] カルボニル ] - 1 - メチル - 4 - [ 4 - (トリフルオロメチル) フェニル ] - 2 - ピロリジニリデン ] ヒドラジド 2, 2 - ジメチルプロパン酸の製造

(3S, 4S) - N - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 1 - メチル - 2 - チオキソ - 4 - [ 4 - (トリフルオロメチル) フェニル ] - 3 - ピロリジンカルボキサミド (即ち、合成例 1 の工程 H の生成物) (150 mg、0.36 mmol) のテトラヒドロフラン (15 mL) 溶液に酢酸水銀 (II) (230 mg、7.24 mmol) とピバロイルヒドラジド (84.5 mg、7.24 mmol) を添加し、反応混合物を 90 に加熱した。12 時間後、反応混合物を室温に冷却し、Celite (登録商標) ケイ藻土ろ過剤を通してろ過した。ろ液を減圧下で濃縮し、粗物質を分取高速液体クロマトグラフィーによって精製して、240 ~ 244 で溶融する固体 (異性体の 71 : 26 混合物) としての表題化合物 25 mg を得た。

<sup>1</sup>H NMR 10.11 (s, 1H), 9.17 (s, 1H), 7.73-7.71 (d, 2H), 7.67-7.61 (d, 3H), 7.17-7.14 (t, 2H), 4.03-4.02 (d, 1H), 3.85-3.80 (t, 1H), 3.69-3.68 (d, 1H), 3.36 (s, 1H), 2.87 (s, 3H), 1.02 (s, 9H).

## 【0227】

当技術分野で公知の方法を伴う本明細書に記載の手法により、表 1 ~ 12 の以下の化合

10

20

30

40

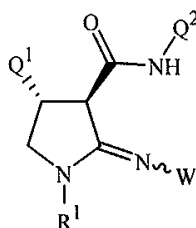
50

物が製造可能である。以下の表において、以下の略語が使用されている：t はターシャリーを意味し、i はイソを意味し、c はシクロを意味し、Et はエチルを意味し、Pr はプロピルを意味し、Bu はブチルを意味し、i-Pr はイソプロピルを意味し、Bu はブチルを意味し、c-Pr はシクロプロピルを意味し、c-Bu はシクロブチルを意味し、Ph はフェニルを意味し、Py はピリジニルを意味し、S(=O) はスルフィニルを意味し、S(=O)<sub>2</sub> はスルホニルを意味する。

【 0 2 2 8 】

【 表 1 】

表 1



R<sup>1</sup>は、CH<sub>3</sub>であり;Q<sup>1</sup>は、Ph(4-CF<sub>3</sub>)であり;Q<sup>2</sup>は、Ph(2,3-ジ-F)であり;Wは、以下の通りである。

W	W	W
-NHCH <sub>3</sub>	-NHPh(3-F)	-NH(S=O)- <i>t</i> -Bu
-NHEt	-NHPh(4-F)	-NH(S=O)CF <sub>3</sub>
-NH- <i>i</i> -Pr	-NHPh(2-CH <sub>3</sub> )	-NH(S=O)Ph
-NH- <i>t</i> -Bu	-NHPh(3-CH <sub>3</sub> )	-NH(S=O)OCH <sub>3</sub>
-NH- <i>c</i> -Pr	-NHPh(4-CH <sub>3</sub> )	-NH(S=O)OEt
-NH- <i>c</i> -ペンチル	-NH-2-Py	-NH(S=O)O- <i>i</i> -Pr
-NH- <i>c</i> -ヘキシル	-NH-3-Py	-NH(S=O)O- <i>t</i> -Bu
-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-NH-4-Py	-NH(S=O)OCF <sub>3</sub>
-NCH <sub>3</sub> Et	-NHCN	-NH(S=O)OPh
-NCH <sub>3</sub> - <i>i</i> -Pr	-NH(C=O)H	-NH(S(=O) <sub>2</sub> )CH <sub>3</sub>
-NCH <sub>3</sub> - <i>t</i> -Bu	-NH(C=O)CH <sub>3</sub>	-NH(S(=O) <sub>2</sub> )Et
-NCH <sub>3</sub> - <i>c</i> -Pr	-NH(C=O)Et	-NH(S(=O) <sub>2</sub> )- <i>i</i> -Pr
-NCH <sub>3</sub> - <i>c</i> -ペンチル	-NH(C=O)- <i>i</i> -Pr	-NH(S(=O) <sub>2</sub> )- <i>t</i> -Bu
-NCH <sub>3</sub> - <i>c</i> -ヘキシル	-NH(C=O)CF <sub>3</sub>	-NH(S(=O) <sub>2</sub> )CF <sub>3</sub>
-NEt <sub>2</sub>	-NH(C=O)Ph	-NH(S(=O) <sub>2</sub> )Ph
-Net- <i>i</i> -Pr	-NH(C=O)OCH <sub>3</sub>	-NH(S(=O) <sub>2</sub> )OCH <sub>3</sub>
-Net- <i>t</i> -Bu	-NH(C=O)OEt	-NH(S(=O) <sub>2</sub> )OEt
-Net- <i>c</i> -Pr	-NH(C=O)O- <i>i</i> -Pr	-NH(S(=O) <sub>2</sub> )O- <i>i</i> -Pr
-Net- <i>c</i> -ペンチル	-NH(C=O)O- <i>t</i> -Bu	-NH(S(=O) <sub>2</sub> )O- <i>t</i> -Bu
-Net- <i>c</i> -ヘキシル	-NH(C=O)OCF <sub>3</sub>	-NH(S(=O) <sub>2</sub> )OCF <sub>3</sub>
-NHPh	-NH(C=O)OPh	-NH(S(=O) <sub>2</sub> )OPh
-NCH <sub>3</sub> Ph	-NH(S=O)CH <sub>3</sub>	-OCF <sub>3</sub>
-NEtPh	-NH(S=O)Et	-OCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-NHPh(2-F)	-NH(S=O)- <i>i</i> -Pr	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

10

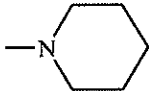
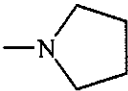
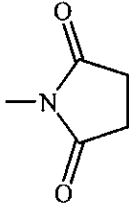
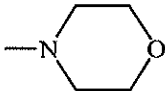
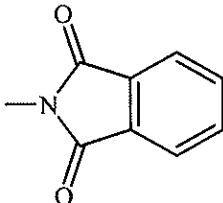
20

30

40

50

【表 2】

W	W	W	
-O- <i>c</i> -Pr	-OPh(4-F)	-O-4-Py	
-O- <i>c</i> -ペンチル	-OPh(2-CH <sub>3</sub> )	-O(C=O)CF <sub>3</sub>	
-O- <i>c</i> -ヘキシル	-OPh(3-CH <sub>3</sub> )	-O(C=O)CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
-OPh	-OPh(4-CH <sub>3</sub> )	-O(C=O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
-OPh(2-F)	-O-2-Py		10
-OPh(3-F)	-O-3-Py		
			
			20

## 【0229】

表2は、表題行「R<sup>1</sup>は、CH<sub>3</sub>であり；Q<sup>1</sup>は、Ph(4-CF<sub>3</sub>)であり；Q<sup>2</sup>は、Ph(2,3-ジ-F)であり；Wは、以下の通りである」が以下の表2に列挙する表題行（即ち、「R<sup>1</sup>は、CH<sub>3</sub>であり；Q<sup>1</sup>は、Ph(4-CF<sub>3</sub>)であり；Q<sup>2</sup>は、Ph(2-F)であり、Wは、以下の通りである」に置き換えられていることを除き、表1と同様に構成されている。表3～12も同様に構成されている。

## 【0230】

30

40

50

【表 3】

表	表題行
2	R <sup>1</sup> は、CH <sub>3</sub> であり;Q <sup>1</sup> は、Ph(4-CF <sub>3</sub> )であり;Q <sup>2</sup> は、Ph(2-F)であり;Wは、以下の通りである
3	R <sup>1</sup> は、CH <sub>3</sub> であり;Q <sup>1</sup> は、Ph(4-CF <sub>3</sub> )であり;Q <sup>2</sup> は、3-Pyr(2,6-ジ-F)であり;Wは、以下の通りである
4	R <sup>1</sup> は、CH <sub>3</sub> であり;Q <sup>1</sup> は、Ph(3-CF <sub>3</sub> )であり;Q <sup>2</sup> は、Ph(2,3-ジ-F)であり;Wは、以下の通りである
5	R <sup>1</sup> は、CH <sub>3</sub> であり;Q <sup>1</sup> は、Ph(3-CF <sub>3</sub> )であり;Q <sup>2</sup> は、Ph(2-F)であり;Wは、以下の通りである
6	R <sup>1</sup> は、CH <sub>3</sub> であり;Q <sup>1</sup> は、Ph(3-CF <sub>3</sub> )であり;Q <sup>2</sup> は、3-Pyr(2,6-ジ-F)であり;Wは、以下の通りである
7	R <sup>1</sup> は、CH <sub>3</sub> であり;Q <sup>1</sup> は、3-Pyr(6-CF <sub>3</sub> )であり;Q <sup>2</sup> は、Ph(2,3-ジ-F)であり;Wは、以下の通りである
8	R <sup>1</sup> は、CH <sub>3</sub> であり;Q <sup>1</sup> は、3-Pyr(6-CF <sub>3</sub> )であり;Q <sup>2</sup> は、Ph(2-F)であり;Wは、以下の通りである
9	R <sup>1</sup> は、CH <sub>3</sub> であり;Q <sup>1</sup> は、3-Pyr(6-CF <sub>3</sub> )であり;Q <sup>2</sup> は、3-Pyr(2,6-ジ-F)であり;Wは、以下の通りである
10	R <sup>1</sup> は、CH <sub>3</sub> であり;Q <sup>1</sup> は、4-Pyr(2-OCHF <sub>2</sub> ,6-CH <sub>3</sub> )であり;Q <sup>2</sup> は、Ph(2,3-ジ-F)であり;Wは、以下の通りである
11	R <sup>1</sup> は、CH <sub>3</sub> であり;Q <sup>1</sup> は、4-Pyr(2-OCHF <sub>2</sub> ,6-CH <sub>3</sub> )であり;Q <sup>2</sup> は、Ph(2-F)であり;Wは、以下の通りである
12	R <sup>1</sup> は、CH <sub>3</sub> であり;Q <sup>1</sup> は、4-Pyr(2-OCHF <sub>2</sub> ,6-CH <sub>3</sub> )であり;Q <sup>2</sup> は、3-Pyr(2,6-ジ-F)であり;Wは、以下の通りである

10

20

30

## 【0231】

本発明の化合物は一般的に、担体として機能する界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分と共に、組成物、即ち、製剤中の除草用有効成分として使用される。製剤または組成物の原材料は、有効成分の物理学的性質、施用形態、および土壌のタイプ、水分および温度のような環境要因と調和するように選択される。

## 【0232】

有用な製剤は、液体組成物および固体組成物の両方を含む。液体組成物としては、液剤（乳剤を含む）、懸濁液、エマルジョン（マイクロエマルジョン、水中油型エマルジョン、フロアブル製剤および/またはサスポエマルジョン製剤を含む）などが挙げられ、これらは、場合により、増粘してゲルとすることが可能である。水性液体組成物の一般的なタイプは、液剤、SC剤、カプセル懸濁液、濃縮エマルジョン、マイクロエマルジョン、水中油型エマルジョン、フロアブル製剤およびサスポエマルジョン製剤である。非水性液体組成物の一般的なタイプは、乳剤、マイクロ乳剤、分散性濃縮物および油分散液である。

40

## 【0233】

固体組成物の一般的なタイプは、粉剤、粉末、粒剤、ペレット、プリル、パスタイル、錠剤、充填フィルム（種子粉衣を含む）等であり、これらは水分散性（「水和性」）または水溶性とすることができる。フィルム形成溶液または流動性懸濁液から形成されたフィルムおよびコーティングは、種子処理に特に有用である。有効成分は（マイクロ）カプセル化することができ、更に懸濁液または固体製剤に形成することができる：あるいは、有

50

効成分の全製剤をカプセル化（または「オーバーコート」）することができる。カプセル化により、有効成分の放出の制御または遅延が可能である。乳化性粒剤は、乳剤製剤と乾燥粒状製剤の両方の利点を兼ね備える。更なる製剤の中間体として、主として高強度組成物が使用される。

#### 【 0 2 3 4 】

噴霧可能な製剤は、典型的には、噴霧前に適切な媒体で希釈される。このような液体および固体製剤は、通常は水であるが、場合によっては芳香族もしくはパラフィン系炭化水素または植物油のような別の適切な媒体である噴霧媒体で容易に希釈されるよう配合される。噴霧量は、ヘクタール当たり約 1 ～ 数千リットルの範囲とすることができるが、より典型的には、ヘクタール当たり約 1 0 ～ 数百リットルの範囲である。噴霧可能な製剤は、空中もしくは地上での施用による葉の処理のために、または、植物の成長培地への施用のために水または別の適切な媒体と、タンク内で混合することが可能である。液体および乾燥製剤は、点滴かんがいシステムに直接計量投入したり、植え付けの最中に畝間に計量投入したりできる。

#### 【 0 2 3 5 】

製剤は、典型的には、合計で 1 0 0 重量%となる以下の適切な範囲内で、有効量の有効成分、希釈剤および界面活性剤を含有する。

#### 【 0 2 3 6 】

#### 【表 4】

	重量%		
	有効成分	希釈剤	界面活性剤
顆粒水和剤および顆粒水溶剤、 錠剤ならびに粉末	0.001-90	0-99.999	0-15
油分散液、懸濁液、エマルジョン、 液剤(乳剤を含む)	1-50	40-99	0-50
粉剤	1-25	70-99	0-5
粒剤およびペレット	0.001-99	5-99.999	0-15
高強度組成物	90-99	0-10	0-2

#### 【 0 2 3 7 】

固体希釈剤には、例えば、ベントナイト、モンモリロナイト、アタパルジャイトおよびカオリンのような粘土、セッコウ、セルロース、二酸化チタン、酸化亜鉛、デンプン、デキストリン、糖類（例えば、ラクトース、スクロース）、シリカ、タルク、マイカ、ケイ藻土、尿素、炭酸カルシウム、炭酸ナトリウムおよび重炭酸ナトリウム、ならびに硫酸ナトリウムが含まれる。典型的な固体希釈剤は、Watkinsら、Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers、第2版、Dorland Books、Caldwell、New Jerseyに記載されている。

#### 【 0 2 3 8 】

液体希釈剤としては、例えば、水、N, N - ジメチルアルカンアミド（例えば、N, N - ジメチルホルムアミド）、リモネン、ジメチルスルホキシド、N - アルキルピロリドン（例えば、N - メチルピロリジノン）、リン酸アルキル（例えば、リン酸トリエチル）、エチレングリコール、トリエチレングリコール、プロピレングリコール、ジプロピレングリコール、ポリプロピレングリコール、炭酸プロピレン、炭酸ブチレン、パラフィン（例えば、白色鉱油、直鎖パラフィン、イソパラフィン）、アルキルベンゼン、アルキルナフ

タレン、グリセリン、三酢酸グリセリン、ソルビトール、芳香族炭化水素、脱芳香族脂肪族化合物、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、シクロヘキサノン、2-ヘプタノン、イソホロンおよび4-ヒドロキシ-4-メチル-2-ペンタノンのようなケトン、酢酸イソアミル、酢酸ヘキシル、酢酸ヘプチル、酢酸オクチル、酢酸ノニル、酢酸トリデシルおよび酢酸イソボルニルのような酢酸エステル、アルキル化乳酸エステル、二塩基性エステル、アルキルおよびアリール安息香酸エステルおよびγ-ブチロラク톤のような他のエステル、ならびに、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロピルアルコール、n-ブタノール、イソブチルアルコール、n-ヘキサノール、2-エチルヘキサノール、n-オクタノール、デカノール、イソデシルアルコール、イソオクタデカノール、セチルアルコール、ラウリルアルコール、トリデシルアルコール、オレイルアルコール、シクロヘキサノール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ジアセトンアルコール、クレゾールおよびベンジルアルコールのような、直鎖、分枝、飽和または不飽和であるアルコールが挙げられる。液体希釈剤としては更に、植物種子油および果実油（例えば、オリーブ油、ヒマシ油、亜麻仁油、ゴマ油、コーン油（トウモロコシ油）、落花生油、ヒマワリ油、グレープシード油、サフラワー油、綿実油、ダイズ油、ナタネ油、ココナツ油およびパーム核油）、動物由来脂肪（例えば、牛脂、豚脂、ラード、タラ肝油、魚油）ならびにそれらの混合物のような飽和および不飽和脂肪酸（典型的にはC<sub>6</sub>~C<sub>22</sub>）のグリセリンエステルも挙げられる。液体希釈剤としては更に、脂肪酸が植物および動物源からのグリセリンエステルの加水分解によって得られ、蒸留によって精製可能なアルキル化脂肪酸（メチル化、エチル化、ブチル化）が挙げられる。典型的な液体希釈剤は、Marsden、Solvents Guide、第2版、Interscience、New York、1950に記載されている。

#### 【0239】

本発明の固体および液体組成物は多くの場合、1種またはそれ以上の界面活性剤を含む。液体に添加した場合、界面活性剤（「表面活性剤」としても公知である）は一般的に、液体の表面張力を変更し、多くの場合は低下させる。界面活性剤分子中の親水性基および親油性基の性質次第で、界面活性剤は、湿潤剤、分散剤、乳化剤または消泡剤として有用となり得る。

#### 【0240】

界面活性剤は、非イオン性、アニオン性またはカチオン性に分類することができる。本組成物にとって有用な非イオン性界面活性剤としては、以下が挙げられるが、これに限定されない：天然および合成アルコール（分枝または直鎖であってもよい）系であり、アルコールおよびエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはそれらの混合物から製造されるアルコールアルコキシラートなどのアルコールアルコキシラート；アミンエトキシラート、アルカノールアミドおよびエトキシ化アルカノールアミド；エトキシ化されたダイズ油、ヒマシ油およびナタネ油のようなアルコキシ化トリグリセリド；オクチルフェノールエトキシラート、ノニルフェノールエトキシラート、ジノニルフェノールエトキシラートおよびドデシルフェノールエトキシラート（フェノールおよびエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはそれらの混合物から製造される）のようなアルキルフェノールアルコキシラート；エチレンオキシドまたはプロピレンオキシドから製造されるブロックポリマーおよび末端ブロックがプロピレンオキシドから製造される逆ブロックポリマー；エトキシ化脂肪酸；エトキシ化脂肪酸エステルおよび油；エトキシ化メチルエステル；エトキシ化トリスチルフェノール（エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはそれらの混合物から製造されるものを含む）；脂肪酸エステル、グリセリンエステル、ラノリン系誘導体、ポリエトキシ化ソルビタン脂肪酸エステル、ポリエトキシ化ソルビトール脂肪酸エステルおよびポリエトキシ化グリセリン脂肪酸エステルのようなポリエトキシラートエステル；ソルビタンエステルなどの他のソルビタン誘導体；ランダムコポリマー、ブロックコポリマー、アルキドペグ（ポリエチレングリコール）樹脂、グラフトまたはコームポリマーおよびスターポリマーなどの高分子界面活性剤；ポリエチレングリコール（ペグ）；ポリエチレ

ングリコール脂肪酸エステル；シリコン系界面活性剤；ならびにスクロースエステル、アルキルポリグリコシドおよびアルキルポリサッカリドのような糖誘導体。

#### 【0241】

有用なアニオン性界面活性剤としては、以下が挙げられるが、これに限定されない：アルキルアリアルスルホン酸およびそれらの塩；カルボキシル化アルコールまたはアルキルフェノールエトキシラート；ジフェニルスルホナート誘導体；リグニンおよびリグノスルホナートのようリグニン誘導体；マレイン酸またはコハク酸またはそれらの無水物；オレフィンスルホナート；アルコールアルコキシラートのリン酸エステル、アルキルフェノールアルコキシラートのリン酸エステルおよびスチリルフェノールエトキシラートのリン酸エステルのようなリン酸エステル；タンパク質系界面活性剤；サルコシン誘導体；スチリルフェノールエーテルスルファート；油および脂肪酸のスルファートおよびスルホナート；エトキシル化アルキルフェノールのスルファートおよびスルホナート；アルコールのスルファート；エトキシル化アルコールのスルファート；N，N - アルキルタウラートのようなアミンおよびアミドのスルホナート；ベンゼン、クメン、トルエン、キシレン、ならびにドデシルおよびトリデシルベンゼンのスルホナート；縮合ナフタレンのスルホナート；ナフタレンおよびアルキルナフタレンのスルホナート；分留された石油のスルホナート；スルホスクシナート；ならびにジアルキルスルホスクシナート塩のようなスルホスクシナートおよびそれらの誘導体。

10

#### 【0242】

有用なカチオン性界面活性剤としては、以下が挙げられるが、これに限定されない：アミドおよびエトキシル化アミド；N - アルキルプロパンジアミン、トリプロピレントリアミンおよびジプロピレンテトラミン、ならびにエトキシル化アミン、エトキシル化ジアミンおよびプロポキシル化アミン（アミンおよびエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはそれらの混合物から製造される）のようなアミン；酢酸アミンのようなアミン塩およびジアミン塩；第四級塩、エトキシル化第四級塩およびジ第四級塩のような第四級アンモニウム塩；ならびにアルキルジメチルアミンオキシドおよびビス - （2 - ヒドロキシエチル） - アルキルアミンオキシドのようなアミンオキシド。

20

#### 【0243】

非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物、または非イオン性界面活性剤とカチオン性界面活性剤との混合物も、本組成物には有用である。非イオン性、アニオン性およびカチオン性界面活性剤ならびにそれらの推奨される使用については、McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, annual American and International Editions, McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 刊行；SiselyおよびWood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964；ならびに、A. S. DavidsonおよびB. Milwidsky, Synthetic Detergents, 第7版, John Wiley and Sons, New York, 1987を含む様々な公表された文献に開示されている。

30

40

#### 【0244】

本発明の組成物は、配合補助剤として当業者に公知である配合助剤および添加剤を更に含有してもよい（これらの一部は、固体希釈剤、液体希釈剤または界面活性剤としても機能すると考えられる）。このような配合助剤および添加剤は、以下を制御し得る：pH（緩衝液）、加工中の発泡（ポリオルガノシロキサンのような消泡剤）、有効成分の沈降（懸濁剤）、粘度（チキソトロピー増粘剤）、容器内微生物の成長（抗菌薬）、生成物の凍結（凍結防止剤）、色（染料／顔料分散剤）、洗い流し（フィルム形成剤または粘着剤）、蒸発（蒸発遅延剤）、および他の製剤属性。フィルム形成剤としては、例えば、ポリ酢酸ビニル、ポリ酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルピロリドン - 酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルアルコール、ポリビニルアルコールコポリマーおよびワックスが挙げられる。

50

配合助剤および添加剤の例としては、McCutcheon's 第2巻: Functional Materials, annual International and North American editions、McCutcheon's Division、The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 刊行; および PCT 公開 WO 03 / 024222 に列挙されるものが挙げられる。

#### 【0245】

式1の化合物および他のいずれかの有効成分は、典型的には、有効成分を溶媒に溶解させることにより、または、液体または乾燥希釈剤中で磨砕することにより、本組成物に組み込まれる。乳剤を含む液剤は、原材料を単純に混合することにより製造することができる。乳剤としての使用が意図される液体組成物の溶媒が非水混和性である場合、乳化剤が、典型的には水での希釈時に活性含有溶媒を乳化するために添加される。2,000 μm までの粒径を有する有効成分スラリーは、媒体ミルを使用して湿式粉碎し、平均径が3 μm 未満の粒子を得ることができる。水性スラリーを最終SC剤へと加工することができ(例えば、U.S. 3,060,084を参照されたい)、または噴霧乾燥によって更に処理して顆粒水和剤を形成することができる。乾燥製剤は、通常、乾式粉碎プロセスを必要とし、それにより2~10 μm 範囲の平均粒径がもたらされる。粉剤および粉末は、ブレンドし、通常は磨砕(ハンマーミルまたは流体エネルギーミルなどで)することにより、製造することができる。粒剤およびペレットは、予備形成された顆粒担体上に活性材料を噴霧することにより、または凝集技法によって製造することができる。Browning、*「Agglomeration」*、Chemical Engineering、1967年12月4日、147~48頁、Perry's Chemical Engineer's Handbook、第4版、McGraw-Hill、New York、1963、8~57頁以降、およびWO 91 / 13546を参照されたい。ペレットは、U.S. 4,172,714に記載されているようにして製造することができる。顆粒水和剤および顆粒水溶剤は、U.S. 4,144,050、U.S. 3,920,442およびDE 3,246,493に教示されるようにして製造することができる。錠剤は、U.S. 5,180,587、U.S. 5,232,701およびU.S. 5,208,030に教示されるように製造することができる。フィルムは、GB 2,095,558およびU.S. 3,299,566に教示されるように製造することができる。

#### 【0246】

製剤技術に関する更なる情報に関しては、T.S. Woods、*「The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture」* in Pesticide Chemistry and Bioscience、The Food-Environment Challenge、T. Brooks および T.R. Roberts 編、Proceedings of the 9<sup>th</sup> International Congress on Pesticide Chemistry、The Royal Society of Chemistry、Cambridge、1999、120~133頁を参照されたい。更に、U.S. 3,235,361、6欄16行~7欄19行および実施例10~41; U.S. 3,309,192、5欄43行~7欄62行ならびに実施例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138~140、162~164、166、167および169~182; U.S. 2,891,855、3欄66行~5欄17行および実施例1~4; Klingman、Weed Control as a Science、John Wiley and Sons, Inc.、New York、1961、81~96頁; Hance、Weed Control Handbook、第8版、Blackwell Scientific Publications、Oxford、1989; および Developments in Formulation Technology、PJB Publications、Richmond、UK、2000を参照されたい。

#### 【0247】



以下の実施例において、パーセンテージは全て重量基準であり、製剤は全て従来法で製造される。化合物番号は、索引表 A における化合物を指す。更なる詳細がなくても、先行する記載を使用する当業者は、本発明を最大限に利用可能であると考えられる。したがって、以下の実施例は、単なる例示に過ぎず、決して本開示を限定するものではないと解釈すべきである。別途記載されていない限り、パーセンテージは重量基準である。

【 0 2 4 8 】

【表 5】

#### 実施例 A

<u>高強度濃縮物</u>		10
化合物 1	98.5%	
シリカエアロゲル	0.5%	
合成非晶質微細シリカ	1.0%	

【 0 2 4 9 】

【表 6】

#### 実施例 B

<u>水和剤</u>		20
化合物 1	65.0%	
ドデシルフェノールポリエチレングリコールエーテル	2.0%	
リグニンスルホン酸ナトリウム	4.0%	
アルミノケイ酸ナトリウム	6.0%	
モンモリロナイト(か焼)	23.0%	

【 0 2 5 0 】

【表 7】

#### 実施例 C

<u>粒剤</u>		
化合物 1	10.0%	
アタパルジャイト顆粒(低揮発性物質、 0.71/0.30mm;U.S.S.No.25-50 篩)	90.0%	

【 0 2 5 1 】

【表 8】

#### 実施例 D

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

【 0 2 5 2 】

【 表 9 】

実施例 E乳剤

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

10

【 0 2 5 3 】

【 表 1 0 】

実施例 Fマイクロエマルション

化合物 1	5.0%
ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー	30.0%
アルキルポリグリコシド	30.0%
モノオレイン酸グリセリル	15.0%
水	20.0%

20

【 0 2 5 4 】

【 表 1 1 】

実施例 GSC 剤

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

30

40

【 0 2 5 5 】

## 【表 1 2】

実施例 H水中エマルジョン

化合物 1	10.0%	
ブチルポリオキシエチレン/ポリプロピレンブロック	4.0%	
コポリマー		
ステアリン酸/ポリエチレングリコールコポリマー	1.0%	
スチレンアクリルポリマー	1.0%	10
キサントガム	0.1%	
プロピレングリコール	5.0%	
シリコーン系消泡剤	0.1%	
1,2-ベンゾイソチアゾリン-3-オン	0.1%	
芳香族石油系炭化水素	20.0	
水	58.7%	

## 【0 2 5 6】

20

## 【表 1 3】

実施例 I油分散液

化合物 1	25%	
ヘキサオレイン酸ポリオキシエチレンソルビトール	15%	
有機修飾ベントナイト粘土	2.5%	
脂肪酸メチルエステル	57.5%	30

## 【0 2 5 7】

本開示は、「化合物 1」を「化合物 2」、「化合物 3」、「化合物 4」、「化合物 5」、「化合物 6」、「化合物 7」または「化合物 8」に置き換えたことを除き、上記実施例 A ~ I を更に含む。試験結果は、本開示の化合物が、活性が高度な発生前処理除草剤および/または発生後処理除草剤および/または植物成長調節剤であることを示している。本発明の化合物は一般的に、発生後雑草防除（即ち、土壌から雑草の実生が出現した後に施用）および発生前雑草防除（即ち、土壌から雑草の実生が出現する前に施用）の場合に最も高い活性を示す。その多くは、燃料保管タンクの周囲、産業用保管領域、駐車場、ドライブインシアター、飛行場、河岸、灌漑用および他の水路、広告板の周囲、ならびに、幹線道路および鉄道構造物のような、全ての植生の完全な防除が望まれる領域における広範囲の発生前および/または発生後雑草防除について実用性を有する。本発明の化合物の多くは、農作物対雑草における選択的な代謝のため、または、農作物および雑草における生理的阻害位置における選択的な活性により、または、農作物と雑草の混合物の環境上または内の選択的な配置により、農作物/雑草混合物中における草および広葉雑草の選択的な防除に有用である。当業者であれば認識することであるが、化合物または化合物群におけるこれらの選択性要因の好適な組合せは、慣例的な生物学および/または生化学的アッセイを実施することにより容易に判定可能である。本発明の化合物は、アルファルファ、オオムギ、ワタ、コムギ、セイヨウアブラナ、サトウダイコン、コーン（トウモロコシ）、ソルガム、ダイズ、イネ、オートムギ、ピーナッツ、野菜、トマト、ジャガイモ、コー

40

50

ヒー、カカオ、アブラヤシ、ゴム、サトウキビ、柑橘類、ブドウ、果樹、堅果樹、バナナ、プランテン、パイナップル、ホップ、茶を含む多年生プランテーション農作物、ならびにユーカリおよび針葉樹（例えば、テダマツ）のような森林、および芝生種（例えば、ケンタッキーブルーグラス、アメリカシバ、ケンタッキーフェスキューおよびギョウギシバ）を含むが、これに限定されない重要な普通農作物に対して耐性を示し得る。本発明の化合物は、遺伝子組換えまたは交配により除草剤に対する耐性が組み込まれ、無脊椎動物有害生物に対して毒性のあるタンパク質（パチルス・チューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）毒素など）を発現し、および/または、他の有用な形質を発現する農作物に用いることが可能である。当業者であれば理解することであるが、当業者は、全ての化合物が全ての雑草に対して等しく効果的であるわけではない。代わりに、本化合物は、植物の成長を改変するのに有用である。

10

#### 【0258】

本発明の化合物は、発生前処理除草および発生後処理除草の両方の活性を有しているため、植生を死滅させる、または植生に損傷を与える、または、その成長を抑制することにより望ましくない植生を防除するには、化合物を、本発明の化合物または前記化合物と界面活性剤、固体希釈剤もしくは液体希釈剤のうちの少なくとも1種を含む組成物の除草有効量を、望ましくない植生の群葉もしくは他の部分に、または、望ましくない植生が成長している土壌もしくは水、または望ましくない植生の種子もしくは他の珠芽の周囲の土壌もしくは水のような望ましくない植生の環境に接触させることを含む多様な方法により有用に施用することができる。望ましくない植生には、草雑草および広葉雑草からなる群から選択される少なくとも1種が含まれる。望ましくない植生は、スズメノカタビラ、マルバツユクサ、ブラックグラス、イヌホオズキ、メリケンニクキビ、セイヨウトゲアザミ、カラスノチャヒキ、オナモミ（キサンチウム・ペンシルバニウム（*Xanthium pensylvanicum*））、ブタクサ、ヒナゲシ、マキバスマレ、アキノエノコログサ、オヒシバ、エノコログサ、ギニアキビ、コセンダングサ、除草剤抵抗性ブラックグラス、ヒメムカシヨモギ、イタリアンライグラス、ヨウシュチョウセンアサガオ、セイバンモロコシ（ソルガム・ハレペンス（*Sorghum halepense*））、オニメヒシバ、リトルシードカナリーグラス、アサガオ、ペンシルバニアスマートウィード、ヒラミホシアサガオ、ブリクリシダ、シバムギ、アオビユ、シャッターケイン、ナズナ、シルキーウィンドグラス、ヒマワリ（ジャガイモ栽培の雑草としての）、ソバカズラ（ポリゴナム・コンボルブルス（*Polygonum convolvulus*））、ノハラガラシ（ブラシカ・カバー（*Brassica kaber*））、カラスムギ（アベナ・ファツア（*Avena fatua*））、ショウジョウソウ、キンエノコロ、およびショクヨウガヤツリ（シペラス・エスクレンタス（*Cyperus esculentus*））からなる群から選択される。

20

30

#### 【0259】

本発明の化合物の除草有効量は、多数の要因によって判定される。これらの要因としては、選択した製剤、施用方法、存在する植生の量およびタイプ、成長条件等が挙げられる。通例では、本発明の化合物の除草有効量は、約0.001~20kg/haであり、約0.004~1kg/haが好適な範囲である。当業者は、所望される雑草防除レベルに必要な除草有効量を容易に判定可能である。

40

#### 【0260】

一般的な一実施形態において、本発明の化合物は、典型的には組成物に配合され、所望の植生（例えば農作物）および望ましくない植生（即ち、雑草）（これらは共に、種子、実生および/またはより成長した植物の場合がある）を含む生息地に対し、成長培地（例えば土壌）に接触させて施用される。この生息地において、本発明の化合物を含む組成物は、特に望ましくない植生の植物もしくはその一部に対し、および/または、植物に接触している成長培地に対し、直接施用することが可能である。

#### 【0261】

本発明の化合物で処理された生息地における所望の植生の植物の変種および栽培変種は

50

、従来の繁殖および交配方法により、または、遺伝子操作法により得ることが可能である。遺伝子操作された植物（遺伝子組換え植物）は、異種遺伝子（導入遺伝子）が植物のゲノムに安定的に組み込まれたものである。植物ゲノムにおける特定の位置により定義される導入遺伝子は、形質転換または遺伝子組換えイベントと呼ばれる。

【0262】

本発明に従い処理可能な生息地における遺伝子操作された植物栽培変種は、1つまたはそれ以上の生物ストレス（線虫、昆虫、ダニ、菌類などのような有害生物）もしくは非生物ストレス（渇水、低温、土壌塩分など）に対して耐性があるもの、または他の望ましい特性を含有するものを含む。植物は、遺伝子操作されて、例えば、除草剤耐性、虫害抵抗性、変性油プロファイルまたは渇水耐性といった形質を示すことが可能である。

10

【0263】

最も典型的には、本発明の化合物は望ましくない植生の防除に用いられるが、処理された生息地における所望の植生に本発明の化合物を接触させることで、遺伝子組換えを介して組み込まれた形質を含む、所望の植生における遺伝形質と、超相加的または相乗的な（強化された）効果がもたらされることがある。例えば、植食性害虫もしくは植物病害に対する抵抗性、生物/非生物ストレスに対する耐性、または、貯蔵安定性が、所望の植生における遺伝形質から予想されるものより大きくなる場合がある。

【0264】

本発明の化合物は更に、除草剤、除草剤薬害軽減剤、殺真菌剤、殺虫剤、抗線虫剤、殺菌剤、殺ダニ剤、昆虫脱皮阻害剤および発根刺激剤のような成長調節剤、不妊化剤、信号化学物質、忌避剤、誘引剤、フェロモン、摂食刺激物質、植物栄養素、他の生物学的活性化合物、または昆虫病原性バクテリア、ウイルスまたは菌類を含む1種またはそれ以上の他の生物学的活性化合物または活性剤と混合することにより多成分型農薬を形成して、農業的保護範囲を更に拡大させることが可能である。本発明の化合物と他の除草剤との混合物は、追加の雑草種に対する活性範囲を拡大し、任意の抵抗性バイオタイプの増殖を抑制することが可能である。したがって、本発明は更に、式1の化合物（除草有効量で）と、少なくとも1種の追加の生物学的活性化合物または活性剤（生物学的に有効な量で）とを含む組成物に関し、界面活性剤、固体希釈剤または液体希釈剤の少なくとも1種を更に含むことが可能である。他の生物学的活性化合物または活性剤を、界面活性剤、固体または液体希釈剤の少なくとも1種を含む組成物に配合することも可能である。本発明の混合物について、1種またはそれ以上の他の生物学的活性化合物もしくは活性剤を式1の化合物と共に配合して予混合物を形成したり、1種またはそれ以上の他の生物学的活性化合物もしくは活性剤を式1の化合物とは別に配合し、製剤を施用前に（例えば、噴霧タンク中で）混ぜ合わせるか、もしくは、交互に連続して施用したりすることが可能である。

20

30

【0265】

以下の除草剤の1種またはそれ以上と本発明の化合物との混合物が、雑草防除に特に有用となり得る：アセトクロール、アシフルオルフェンおよびそのナトリウム塩、アクロニフェン、アクロレイン（2-プロペナール）、アラクロール、アロキシジム、アメトリン、アミカルバゾン、アミドスルフロン、アミノシクロピラクロールおよびそのエステル（例えば、メチル、エチル）および塩（例えば、ナトリウム、カリウム）、アミノピラリド、アミトロール、スルファミン酸アンモニウム、アニロホス、アシュラム、アトラジン、アジメスルフロン、ベフルブタミド、S-ベフルブタミド、ベナゾリン、ベナゾリン-エチル、ベンカルバゾン、ベンフルラリン、ベンフレセート、ベンスルフロン-メチル、ベンスリド、ベントゾン、ベンゾピシクロン、ベンゾフェナップ、ピシクロピロン、ピフェノックス、ピラナホス、ビスピリバックおよびそのナトリウム塩、プロマシル、プロモブチド、プロモフェノキシム、プロモキシニル、オクタン酸プロモキシニル、ブタクロール、ブタフェナシル、ブタミホス、ブトラリン、ブトロキシジム、ブチレート、カフェンストロール、カルベタミド、カルフェントラゾン-エチル、カテキン、クロメトキシフェン、クロラムベン、クロルプロムロン、クロルフルレノール-メチル、クロリダゾン、クロリムロン-エチル、クロロトルロン、クロルプロファム、クロルスルフロン、クロルタール

40

50

- ジメチル、クロルチアミド、シニドン - エチル、シンメシリン、シノスルフロ、クラシホス、クレホキシジム、クレトジム、クロジナホップ - プロパルギル、クロマゾン、クロメプロップ、クロピラリド、クロピラリド - オラミン、クロランスラム - メチル、クミルロン、シアナジン、シクロエート、シクロピラニル、シクロピリモレート、シクロスルファミロン、シクロキシジム、シハロホップ - ブチル、2, 4 - D およびそのブトチル、ブチル、イソオクチルおよびイソプロピルエステルおよびそのジメチルアンモニウム、ジオラミンおよびトトラミン塩、ダイムロン、ダラボン、ダラボン - ナトリウム、ダゾメット、2, 4 - DB およびそのジメチルアンモニウム、カリウムおよびナトリウム塩、デスメディファミン、デスメトリン、ジカンバおよびそのジグリコールアンモニウム、ジメチルアンモニウム、カリウムおよびナトリウム塩、ジクロベニル、ジクロルプロップ、ジクロホップ - メチル、ジクロスラム、メチル硫酸ジフェンゾコート、ジフルフェニカン、ジフルフェンゾピル、ジメフロ、ジメピペレート、ジメタクロール、ジメタメトリン、ジメテナミド、ジメテナミド - P、ジメチピン、ジメチルアルシン酸およびそのナトリウム塩、ジニトロアミン、ジノテルブ、ジフェナミド、ジクワットジプロミド、ジチオピル、ジウロン、DNOC、エンドタール、EPTC、エスプロカルブ、エタルフルラリン、エタメツルフロ - メチル、エチオジン、エトフメセート、エトキシフェン、エトキシスルフロ、エトベンザニド、フェノキサプロップ - エチル、フェノキサプロップ - P - エチル、フェノキサスルホン、フェンキノトリオン、フェントラザミド、フェヌロン、フェヌロン - TCA、フラムプロップ - メチル、フラムプロップ - M - イソプロピル、フラムプロップ - M - メチル、フラザスルフロ、フロラスラム、フルアジホップ - ブチル、フルアジホップ - P - ブチル、フルアゾレート、フルカルバゾン、フルセトスルフロ、フルクロラリン、フルフェナセット、フルフェンピル、フルフェンピル - エチル、フルメツラム、フルミクロラック - ペンチル、フルミオキサジン、フルオメツロン、フルオログリコフェン - エチル、フルポキサム、フルピルスルフロ - メチルおよびそのナトリウム塩、フルレノール、フルレノール - ブチル、フルリドン、フルロクロリドン、フルロキシピル、フルルタモン、フルチアセット - メチル、フォメサフェン、ホラムスルフロ、ホサミン - アンモニウム、グルホシネート、グルホシネート - アンモニウム、グルホシネート - P、アンモニウム、イソプロピルアンモニウム、カリウム、ナトリウム（セスキナトリウムを含む）およびトリメシウム（代替的にスルホサートとも呼ばれる）のような、グリホサートおよびその塩、ハラウキシフェン、ハラウキシフェン - メチル、ハロスルフロ - メチル、ハロキシホップ - エトチル、ハロキシホップ - メチル、ヘキサジノン、ヒダントシジン、イマザメタベンズ - メチル、イマザモックス、イマザピク、イマザピル、イマザキン、イマザキン - アンモニウム、イマゼタピル、イマゼタピル - アンモニウム、イマゾスルフロ、インダノファン、インダジフラム、イオフェンスルフロ、ヨードスルフロ - メチル、アイオキシニル、オクタン酸アイオキシニル、アイオキシニル - ナトリウム、イブフェンカルバゾン、イソプロツロン、イソウロン、イソキサベン、イソキサフルトール、イソキサクロルトール、ラクトフェン、レナシル、リニユロン、マレイン酸ヒドラジド、MCPA およびその塩（例えば、MCPA - ジメチルアンモニウム、MCPA - カリウムおよび MCPA - ナトリウム、エステル（例えば、MCPA - 2 - エチルヘキシル、MCPA - ブトチル）およびチオエステル（例えば、MCPA - チオエチル）、MCPB およびその塩（例えば、MCPB - ナトリウム）およびエステル（例えば、MCPB - エチル）、メコプロップ、メコプロップ - P、メフェンアセト、メフルイジド、メソスルフロ - メチル、メソトリオン、メタム - ナトリウム、メタミホップ、メタミトロン、メタザクロル、メタゾスルフロ、メタベンズチアズロン、メチルアルソン酸およびそのカルシウム、一アンモニウム、一ナトリウムおよび二ナトリウム塩、メチルジムロン、メトベンズロン、メトプロムロン、メトラクロル、S - メトラクロル、メトスラム、メトキスロン、メトリブジン、メトスルフロ - メチル、モリネート、モノリヌロン、ナプロアニリド、ナプロップアミド、ナプロップアミド - M、ナプタラム、ネブロン、ニコスルフロ、ノルフルラゾン、オルベンカルブ、オルトスルファミロン、オリザリン、オキサジアルギル、オキサジアゾン、オキサスルフロ、オキサジクロメホン、オキシフルオルフェン

10

20

30

40

50

、パラコートジクロリド、ペブレート、ペラルゴン酸、ペンジメタリン、ペノキスラム、ペンタノクロル、ペントキサゾン、ペルフルイドン、ペトキサミド、ペトキシアミド、フェンメジファミン、ピクロラム、ピクロラム - カリウム、ピコリナフェン、ピノキサデン、ピペロホース、プレチラクロル、プリミスルフロ - メチル、プロジアミン、プロホキシジウム、プロメトン、プロメトリン、プロバクロル、プロパニル、プロパキザホップ、プロパジン、プロファミン、プロピソクロル、プロボキシカルバゾン、プロピリスルフロ - プロピズアミド、プロスルホカルブ、プロスルフロ - ピラクロニル、ピラフルフェン - エチル、ピラスルホトール、ピラゾギル、ピラゾリネート、ピラゾキシフェン、ピラゾスルフロ - エチル、ピリベンゾオキシム、ピリブチカルブ、ピリデート、ピリフタリド、ピリミノバク - メチル、ピリミスルファン、ピリチオバク、ピリチオバク - ナトリウム、ピロキサスルホン、ピロキシスラム、キンクロラク、キンメラク、キノクラミン、キザロホップ - エチル、キザロホップ - P - エチル、キザロホップ - P - テフリル、リムスルフロ - サフルフェナシル、セトキシジウム、シズロン、シマジン、シメトリン、スルコトリオン、スルフェントラゾン、スルホメツロン - メチル、スルホスルフロ - 2, 3, 6 - TBA, TCA, TCA - ナトリウム、トブタム、トブチウロン、テフリルトリオン、テンボトリオン、テブラロキシジウム、テルバシル、テルブメトン、テルブチルアジン、テルブトリン、テニルクロル、チアゾピル、チエンカルバゾン、チフェンスルフロ - メチル、チオベンカルブ、チアフェナシル、チオカルバジル、トルピラレート、トブラメゾン、トラルコキシジウム、トリ - アレート、トリアファモン、トリアスルフロ - トリアジフラム、トリベヌロン - メチル、トリクロピル、トリクロピル - ブトチル、トリクロピル - トリエチルアンモニウム、トリジファン、トリエタジン、トリフロキシスルフロ - トリフルジモキサジン、トリフルラリン、トリフルスルフロ - メチル、トリトスルフロ - ベルノレート、3 - (2 - クロロ - 3, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 1, 5 - ナフチリジン - 2 (1H) - オン、5 - クロロ - 3 - [(2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル)カルボニル] - 1 - (4 - メトキシフェニル) - 2 (1H) - キノキサリノン、2 - クロロ - N - (1 - メチル - 1H - テトラゾール - 5 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジンカルボキサミド、7 - (3, 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 5 - (2, 2 - ジフルオロエチル) - 8 - ヒドロキシピリド [2, 3 - b] ピラジン - 6 (5H) - オン、4 - (2, 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6 - ジメチル - 3 (2H) - ピリダジノン、5 - [[ (2, 6 - ジフルオロフェニル)メトキシ]メチル] - 4, 5 - ジヒドロ - 5 - メチル - 3 - (3 - メチル - 2 - チエニル)イソオキサゾール (以前はメチオキシリオン)、4 - (4 - フルオロフェニル) - 6 - [(2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル)カルボニル] - 2 - メチル - 1, 2, 4 - トリアジン - 3, 5 (2H, 4H) - ジオン、メチル 4 - アミノ - 3 - クロロ - 6 - (4 - クロロ - 2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) - 5 - フルオロ - 2 - ピリジンカルボキシレート、2 - メチル - 3 - (メチルスルホニル) - N - (1 - メチル - 1H - テトラゾール - 5 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル)ベンズアミドおよび 2 - メチル - N - (4 - メチル - 1, 2, 5 - オキサジアゾール - 3 - イル) - 3 - (メチルスルフィニル) - 4 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド。その他の除草剤としては、アルテルナリア・デストルエンシ・シモンズ (*Alternaria destruens* Simmons)、コレトリカム・グロエオスポリオドズ (*Colletotrichum gloeosporioides*) (Penz.) Penz. & Sacc., ドレシユイエラ・モノセラ (*Drechslera monoceras*) (MTB - 951)、ミロテシウム・ベルカリア (*Myrothecium verrucaria*) (Albertini & Schweinitz) Ditmar: Fries、フィトフトラ・パルミボラ (*Phytophthora palmivora*) (Butl.) Butl. およびプッシニア・テラスペオス (*Puccinia thlaspeos* Schub) などの生物除草剤も挙げられる。

【0266】

望ましくない植生のより良好な防除 (例えば、相加的を超える効果、防除される雑草の

10

20

30

40

50

範囲の拡大、または、農作物の安全性の強化などによる使用量の低減)のために、または抵抗性雑草の発生を防止するために、本発明の化合物と、アトラジン、アジメスルフロン、ベフルブトアミド、S-ベフルブトアミド、ベンゾイソチアゾリノン、カルフェントラゾン-エチル、クロリムロン-エチル、クロルスルフロン-メチル、クロマゾン、クロピラリドカリウム、クロランスラム-メチル、2-[ (2,5-ジクロロフェニル)メチル]-4,4-ジメチル-3-イソオキサゾリジノン、エタメトスルフロン-メチル、フルメツラム、4-(4-フルオロフェニル)-6-[ (2-ヒドロキシ-6-オキソ-1-シクロヘキセン-1-イル)カルボニル]-2-メチル-1,2,4-トリアジン-3,5-(2H,4H)-ジオン、フルピルスルフロン-メチル、フルチアセト-メチル、ホメサフェン、イマゼタピル、レナシル、メソトリオン、メトリブジン、メトスルフロン-メチル、ペトキサミド、ピクロラム、ピロキサスルホン、キンクロラク、リムスルフロン、S-メトラクロル、スルフェントラゾン、チフェンスルフロン-メチル、トリフルスルフロン-メチル、およびトリベヌロン-メチルからなる群から選択される除草剤との混合物が好適である。

10

#### 【0267】

本発明の化合物は更に、アビグリシン、N-(フェニルメチル)-1H-プリン-6-アミン、エボコレオン、ジベレリン酸、ジベレリンA<sub>4</sub>およびA<sub>7</sub>、ハルピンタンパク質、メピコートクロリド、プロヘキサジオンカルシウム、プロヒドロジャスモン、ナトリウムニトロフェノラートおよびトリネキサパック-メチル、ならびに、バチルス・セレウス(*Bacillus cereus*)菌株BP01のような植物の成長を改変する生体などの植物成長調節剤と組み合わせて用いることが可能である。

20

#### 【0268】

農業用保護剤(即ち、除草剤、除草剤薬害軽減剤、殺虫剤、殺菌剤、殺線虫剤、殺ダニ剤および生物剤)に関する一般的な参考文献としては、The Pesticide Manual、第13版、C.D.S.Tomlin編、British Crop Protection Council、Farnham, Surrey, U.K., 2003およびThe BioPesticide Manual、第2版、L.G.Copping編、British Crop Protection Council、Farnham, Surrey, U.K., 2001が挙げられる。

#### 【0269】

30

これらの様々な混合パートナーの1種またはそれ以上が用いられる実施形態について、混合パートナーは、典型的には、混合物パートナーが単独で使用される場合に慣例となっている量と同様の量で使用される。より詳細には、混合物において、有効成分は多くの場合、製品のラベルに有効成分を単独で用いる場合に指定されている施用量の半分から全量の施用量で施用される。これらの量は、The Pesticide Manual、および、The BioPesticide Manualなどの参考文献に列挙されている。式1の化合物に対するこれらの様々な混合パートナー(合計)の重量比は、典型的には、約1:3000と約3000:1の間である。注目すべきは、約1:300と約300:1の間の重量比(例えば、約1:30と約30:1の間の比)である。当業者は、所望の範囲の生物学的活性に必要な有効成分の生物学的有効量を単純な実験を通して容易に判定することが可能である。これらの追加の成分を包含することで、防除される雑草の範囲を、式1の化合物単独で防除される範囲を超えて拡大し得ることが明らかである。

40

#### 【0270】

場合によっては、本発明の化合物と他の生物学的活性(特に除草性)化合物または活性剤(即ち、有効成分)との組合せは、雑草に対して相加的を超える(即ち、相乗的(強化された))効果をもたらす、および/または、農作物または他の望ましい植物に対して拮抗作用(即ち、毒性緩和)をもたらすことが可能である。効果的な有害生物の防除を確保しつつ、環境中に放出される有効成分の量を低減させることが常に望ましい。より多くの量の有効成分を用いて、過剰な農作物被害を伴うことなくより効果的な雑草防除をもたらす能力も同様に望ましい。雑草に対する除草用有効成分の相乗作用(強化された効果)が

50



農学的に十分なレベルの雑草防除をもたらす施用量で生じる場合、このような組合せは、農作物生産コストの削減および環境負荷の低減に有利となり得る。除草用有効成分の毒性緩和が農作物に生じる場合、このような組合せは、雑草との競合を低減させることによる農作物保護の強化に有利となり得る。

#### 【0271】

注目すべきは、本発明の化合物と少なくとも1種の他の除草用有効成分との組合せである。特に注目すべきは、他の除草用有効成分が本発明の化合物とは異なる作用部位を有するような組合せである。場合によっては、同様の防除範囲を有するが作用部位が異なる少なくとも1種の他の除草用有効成分との組合せが、耐性管理に関して特に有利となる。したがって、本発明の組成物は、同様の防除範囲を有するが作用部位が異なる少なくとも1種の追加の除草用有効成分を（除草有効量で）更に含むことが可能である。

10

#### 【0272】

本発明の化合物は更に、アリドクロル、ベノキサコル、クロキントセト - メキシル、クミルウロン、シオメトリニル、シプロスルホンアミド、ダイムロン、ジクロロミド、ジシクロノナ、ジエトレート、ジメピペレート、フェンクロラゾール - エチル、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン - エチル、メフェンビル - ジエチル、メフェネート、メトキシフェノン、ナフタル酸無水物（1, 8 - ナフタル酸無水物）、オキサベトリニル、N - （アミノカルボニル） - 2 - メチルベンゼンスルホンアミド、N - （アミノカルボニル） - 2 - フルオロベンゼンスルホンアミド、1 - ブロモ - 4 - [（クロロメチル）スルホニル] ベンゼン（BCS）、4 - （ジクロロアセチル） - 1 - オキサ - 4 - アゾスピロ[4.5]デカン（MON 4660）、2 - （ジクロロメチル） - 2 - メチル - 1, 3 - ジオキソラン（MG191）、エチル 1, 6 - ジヒドロ - 1 - （2 - メトキシフェニル） - 6 - オキソ - 2 - フェニル - 5 - ピリミジンカルボキシレート、2 - ヒドロキシ - N, N - ジメチル - 6 - （トリフルオロメチル）ピリジン - 3 - カルボキサミド、および 3 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル 1 - （3, 4 - ジメチルフェニル） - 1, 6 - ジヒドロ - 6 - オキソ - 2 - フェニル - 5 - ピリミジンカルボキシレート、2, 2 - ジクロロ - 1 - （2, 2, 5 - トリメチル - 3 - オキサゾリジニル） - エタノンおよび 2 - メトキシ - N - [[4 - [(メチルアミノ)カルボニル]アミノ]フェニル]スルホニル] - ベンズアミドのような除草剤薬害軽減剤と組み合わせて使用し、特定の農作物の安全性を高めることが可能である。除草剤薬害軽減剤の解毒的に有効な量は、本発明の化合物と同時に、または、種子処理として施用可能である。したがって、本発明の態様は、本発明の化合物と、解毒的に有効な量の除草剤薬害軽減剤とを含む除草用混合物に関する。解毒が物理的に農作物植物に限定されるために、種子処理が選択的な雑草防除に特に有用である。したがって、本発明の特に有用な実施形態は、農作物の生息地に除草有効量の本発明の化合物を接触させる工程を含む、農作物における望ましくない植生の成長を選択的に防除する方法であり、ここでは、農作物が成長する種子が解毒的に有効な量の薬害軽減剤で処理される。解毒的に有効な量の薬害軽減剤は、単純な実験を通じて当業者により容易に判定可能である。

20

30

#### 【0273】

本発明の化合物は更に、以下と混合することが可能である：（1）除草効果をもたらす遺伝由来の転写産物のダウンレギュレーション、干渉、抑制またはサイレンシングを通じて特定標的の量に影響を与えるDNA、RNA、および/または化学的に修飾されたヌクレオチドを含むがこれに限定されないポリヌクレオチド；または（2）薬害軽減効果をもたらす遺伝由来の転写産物のダウンレギュレーション、干渉、抑制またはサイレンシングを通じて特定標的の量に影響を与えるDNA、RNA、および/または化学的に修飾されたヌクレオチドを含むがこれに限定されないポリヌクレオチド。

40

#### 【0274】

注目すべきは、本発明の化合物（除草有効量で）と、他の除草剤および除草剤薬害軽減剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の有効成分（有効量で）と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の成分とを含

50

む組成物である。

【 0 2 7 5 】

表 A 1 には、本発明の混合物、組成物および方法の例示である、成分 ( a ) と、成分 ( b ) の特定の組合せが列挙されている。成分 ( a ) 欄中の化合物 1 ( 即ち、「 C m p d . N o . 」は、「化合物番号」を表す) が、索引表 A において特定されている。表 A 1 の第 2 の欄には、特定の成分 ( b ) 化合物 ( 例えば、第 1 行に「 2 , 4 - D 」) が列挙されている。表 A 1 の第 3、第 4 および第 5 欄には、圃場で栽培されている農作物に対し、成分 ( b ) に対して成分 ( a ) 化合物が典型的に施用される割合の重量比 ( 即ち、 ( a ) : ( b ) ) の範囲が列挙されている。したがって、例えば、表 A 1 の第 1 行には、成分 ( a ) ( 即ち、索引表 A の化合物 1 ) と 2 , 4 - D との組合せは、典型的には、 1 : 1 9 2 と 6 : 1 の間の重量比で施用されることが具体的に開示されている。表 A 1 の残りの行も、同様に解釈すべきである。

10

【 0 2 7 6 】

20

30

40

50

【表 1 4】

表 A1

成分(a) (化合物番号)	成分(b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
1	2,4-D	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	アセトクロル	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	アシフルオルフェン	1:96 - 12:1	1:32 - 4:1	1:12 - 1:2
1	アクロニフェン	1:857 - 2:1	1:285 - 1:3	1:107 - 1:12
1	アラクロル	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	アメトリン	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	アミカルバゾン	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	アミドスルフロ	1:6 - 168:1	1:2 - 56:1	1:1 - 11:1
1	アミノシクロピラクロ	1:48 - 24:1	1:16 - 8:1	1:6 - 2:1
1	アミノピラリド	1:20 - 56:1	1:6 - 19:1	1:2 - 4:1
1	アミトロール	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	アニロホス	1:96 - 12:1	1:32 - 4:1	1:12 - 1:2
1	アスラム	1:960 - 2:1	1:320 - 1:3	1:120 - 1:14
1	アトラジン	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	アジムスルフロ	1:6 - 168:1	1:2 - 56:1	1:1 - 11:1
1	ベフルブトアミド	1:342 - 4:1	1:114 - 2:1	1:42 - 1:5
1	S-ベフルブトアミド	1:171 - 4:0.5	1:57 - 2:0.5	1:21 - 1:2.5
1	ベンフレセート	1:617 - 2:1	1:205 - 1:2	1:77 - 1:9
1	ベンスルフロ-メチル	1:25 - 45:1	1:8 - 15:1	1:3 - 3:1
1	ベнтаゾン	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	ベンゾビシクロ	1:85 - 14:1	1:28 - 5:1	1:10 - 1:2
1	ベンゾフェナブ	1:257 - 5:1	1:85 - 2:1	1:32 - 1:4
1	ビシクロピロン	1:42 - 27:1	1:14 - 9:1	1:5 - 2:1
1	ピフェノキス	1:257 - 5:1	1:85 - 2:1	1:32 - 1:4
1	ビスピリバク-ナトリウム	1:10 - 112:1	1:3 - 38:1	1:1 - 7:1
1	プロマシル	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	プロモブチド	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	プロモキシニル	1:96 - 12:1	1:32 - 4:1	1:12 - 1:2
1	ブタクロル	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	ブタフェナシル	1:42 - 27:1	1:14 - 9:1	1:5 - 2:1
1	ブチレート	1:1542 - 1:2	1:514 - 1:5	1:192 - 1:22
1	カルフェンストロール	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3

10

20

30

40

50

【表 15】

成分(a) (化合物番号)	成分(b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
1	カルフェントラゾン-エチル	1:128-9:1	1:42-3:1	1:16-1:2
1	クロリムロン-エチル	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
1	クロロトルロン	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
1	クロルスルフロ	1:6-168:1	1:2-56:1	1:1-11:1
1	シンコスルフロ	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	シニドン-エチル	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	シンメチリン	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
1	クラシホス	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
1	クレトジム	1:48-24:1	1:16-8:1	1:6-2:1
1	クロジナホップ-プロパルギル	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
1	クロマゾン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	クロメプロップ	1:171-7:1	1:57-3:1	1:21-1:3
1	クロピラリド	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	クロランスラム-メチル	1:12-96:1	1:4-32:1	1:1-6:1
1	クミルウロン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	シアナジン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	シクロピリモレート	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	シクロスルファミロン	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	シクロキシジム	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
1	シハロホップ	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
1	ダイムロン	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	デスメジファミ	1:322-4:1	1:107-2:1	1:40-1:5
1	ジカンバ	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	ジクロベニル	1:1371-1:2	1:457-1:4	1:171-1:20
1	ジクロルプロップ	1:925-2:1	1:308-1:3	1:115-1:13
1	ジクロホップ-メチル	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	ジクロスラム	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
1	ジフェンゾクアット	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
1	ジフルフェニカン	1:857-2:1	1:285-1:3	1:107-1:12
1	ジフルフェンゾピル	1:12-96:1	1:4-32:1	1:1-6:1
1	ジメタクロル	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
1	ジメタメトリン	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	ジメテンアミド-P	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	ジチオピル	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	ジウロン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6

10

20

30

40

50

【表 16】

成分(a) (化合物番号)	成分(b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
1	EPTC	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
1	エスプロカルブ	1:1371-1:2	1:457-1:4	1:171-1:20
1	エタルフルラリン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	エタメトスルフロソ-メチル	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	エトキシフェン	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
1	エトキシスルフロソ	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
1	エトベンザニド	1:257-5:1	1:85-2:1	1:32-1:4
1	フェノキサプロソ-エチル	1:120-10:1	1:40-4:1	1:15-1:2
1	フェノキサスルホン	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
1	フェンキノトリオン	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	フェントラズアミド	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	フラザスルフロソ	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	フロラスラム	1:2-420:1	1:1-140:1	2:1-27:1
1	フルアジホソ-プチル	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	フルカルバソソ	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
1	フルセトスルフロソ	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
1	フルフェンアセト	1:257-5:1	1:85-2:1	1:32-1:4
1	フルメツラム	1:24-48:1	1:8-16:1	1:3-3:1
1	フルミクロラク-ペンチル	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
1	フルミオキサジン	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
1	フルオメツロン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	フルピルスルフロソ-メチル	1:3-336:1	1:1-112:1	2:1-21:1
1	フルリドン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	フルロキシピル	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
1	フルルタモン	1:857-2:1	1:285-1:3	1:107-1:12
1	フルチアセト-メチル	1:48-42:1	1:16-14:1	1:3-3:1
1	ホメサフェン	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
1	ホラムスルフロソ	1:13-84:1	1:4-28:1	1:1-6:1
1	グルホシネート	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
1	グリホサート	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
1	ハロスルフロソ-メチル	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	ハラウキシフェン	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
1	ハラウキシフェン メチル	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
1	ハロキシホソ-メチル	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
1	ヘキサジノン	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3

10

20

30

40

【表 17】

成分(a) (化合物番号)	成分(b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
1	ヒダントシジン	1:1100 – 16:1	1:385 – 8:1	1:144 – 4:1
1	イマザモキス	1:13 – 84:1	1:4 – 28:1	1:1 – 6:1
1	イマザピック	1:20 – 56:1	1:6 – 19:1	1:2 – 4:1
1	イマザピル	1:85 – 14:1	1:28 – 5:1	1:10 – 1:2
1	イマザキン	1:34 – 34:1	1:11 – 12:1	1:4 – 3:1
1	イマゼタベンゾ-メチル	1:171 – 7:1	1:57 – 3:1	1:21 – 1:3
1	イマゼタピル	1:24 – 48:1	1:8 – 16:1	1:3 – 3:1
1	イマゾスルフロソ	1:27 – 42:1	1:9 – 14:1	1:3 – 3:1
1	インダノファン	1:342 – 4:1	1:114 – 2:1	1:42 – 1:5
1	インダジフラム	1:25 – 45:1	1:8 – 15:1	1:3 – 3:1
1	ヨードスルフロソ-メチル	1:3 – 336:1	1:1 – 112:1	2:1 – 21:1
1	イオキシニル	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	イプフェンカルバゾン	1:85 – 14:1	1:28 – 5:1	1:10 – 1:2
1	イソプロツロン	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	イソキサベン	1:288 – 4:1	1:96 – 2:1	1:36 – 1:4
1	イソキサフルツール	1:60 – 20:1	1:20 – 7:1	1:7 – 2:1
1	ラクトフェン	1:42 – 27:1	1:14 – 9:1	1:5 – 2:1
1	レナシル	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	リヌロン	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	MCPA	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	MCPB	1:288 – 4:1	1:96 – 2:1	1:36 – 1:4
1	メコプロップ	1:768 – 2:1	1:256 – 1:2	1:96 – 1:11
1	メフェンアセト	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	メフルイジド	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	メソスルフロソ-メチル	1:5 – 224:1	1:1 – 75:1	1:1 – 14:1
1	メソトリオン	1:42 – 27:1	1:14 – 9:1	1:5 – 2:1
1	メタミホップ	1:42 – 27:1	1:14 – 9:1	1:5 – 2:1
1	メタザクロル	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	メタゾスルフロソ	1:25 – 45:1	1:8 – 15:1	1:3 – 3:1
1	メタベンズチアズロン	1:768 – 2:1	1:256 – 1:2	1:96 – 1:11
1	メトラクロル	1:768 – 2:1	1:256 – 1:2	1:96 – 1:11
1	メトスラム	1:8 – 135:1	1:2 – 45:1	1:1 – 9:1
1	メトリブジン	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	メトスルフロソ-メチル	1:2 – 560:1	1:1 – 187:1	3:1 – 35:1
1	モリネート	1:1028 – 2:1	1:342 – 1:3	1:128 – 1:15

10

20

30

40

50

【表 18】

成分(a) (化合物番号)	成分(b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
1	ナブロップアミド	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	ナブロップアミド-M	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	ナブタラム	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	ニコスルフロソ	1:12-96:1	1:4-32:1	1:1-6:1
1	ノルフルラソソ	1:1152-1:1	1:384-1:3	1:144-1:16
1	オルベンカルブ	1:1371-1:2	1:457-1:4	1:171-1:20
1	オルトスルファムロン	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
1	オリザリン	1:514-3:1	1:171-1:2	1:64-1:8
1	オキサジアルギル	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	オキサジアソソ	1:548-3:1	1:182-1:2	1:68-1:8
1	オキサスルフロソ	1:27-42:1	1:9-14:1	1:3-3:1
1	オキサジクロメホン	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
1	オキシフルオルフェソ	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	バラクアット	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	ペンジメタリン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	ペノキスラム	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
1	ペントキサミド	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	ペントキサソソ	1:102-12:1	1:34-4:1	1:12-1:2
1	フェンメジファム	1:102-12:1	1:34-4:1	1:12-1:2
1	ピクロラム	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
1	ピコリナフェソ	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
1	ピノキサデン	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
1	プレチラクロル	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	プリミスルフロソ-メチル	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
1	プロジアミン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	プロホキシジム	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
1	プロメトリン	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	プロパクロル	1:1152-1:1	1:384-1:3	1:144-1:16
1	プロパニル	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	プロパキサホップ	1:48-24:1	1:16-8:1	1:6-2:1
1	プロボキシカルバソソ	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	プロピリスルフロソ	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	プロビズアミド	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
1	プロスルホカルブ	1:1200-1:2	1:400-1:4	1:150-1:17
1	プロスルフロソ	1:6-168:1	1:2-56:1	1:1-11:1

10

20

30

40

50

【表 19】

成分(a) (化合物番号)	成分(b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
1	ピラクロニル	1:42 – 27:1	1:14 – 9:1	1:5 – 2:1
1	ピラフルフェン-エチル	1:5 – 224:1	1:1 – 75:1	1:1 – 14:1
1	ピラスルホトール	1:13 – 84:1	1:4 – 28:1	1:1 – 6:1
1	ピラゾリネート	1:857 – 2:1	1:285 – 1:3	1:107 – 1:12
1	ピラゾスルフロ-エチル	1:10 – 112:1	1:3 – 38:1	1:1 – 7:1
1	ピラゾキシフェン	1:5 – 224:1	1:1 – 75:1	1:1 – 14:1
1	ピリベンゾオキシム	1:10 – 112:1	1:3 – 38:1	1:1 – 7:1
1	ピリプチカルブ	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	ピリデート	1:288 – 4:1	1:96 – 2:1	1:36 – 1:4
1	ピリフタリド	1:10 – 112:1	1:3 – 38:1	1:1 – 7:1
1	ピリミノバク-メチル	1:20 – 56:1	1:6 – 19:1	1:2 – 4:1
1	ピリミスルファン	1:17 – 68:1	1:5 – 23:1	1:2 – 5:1
1	ピリチオバク	1:24 – 48:1	1:8 – 16:1	1:3 – 3:1
1	ピロキサスルホン	1:85 – 14:1	1:28 – 5:1	1:10 – 1:2
1	ピロキシスラム	1:5 – 224:1	1:1 – 75:1	1:1 – 14:1
1	キンクロラク	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	キザロホップ-エチル	1:42 – 27:1	1:14 – 9:1	1:5 – 2:1
1	リムスルフロ	1:13 – 84:1	1:4 – 28:1	1:1 – 6:1
1	サフルフェナシル	1:25 – 45:1	1:8 – 15:1	1:3 – 3:1
1	セトキシジム	1:96 – 12:1	1:32 – 4:1	1:12 – 1:2
1	シマジン	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	スルコトリオン	1:120 – 10:1	1:40 – 4:1	1:15 – 1:2
1	スルフェントラゾン	1:147 – 8:1	1:49 – 3:1	1:18 – 1:3
1	スルホメツロン-メチル	1:34 – 34:1	1:11 – 12:1	1:4 – 3:1
1	スルホスルフロ	1:8 – 135:1	1:2 – 45:1	1:1 – 9:1
1	トプチウロン	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	テフリルトリオン	1:42 – 27:1	1:14 – 9:1	1:5 – 2:1
1	テンボトリオン	1:31 – 37:1	1:10 – 13:1	1:3 – 3:1
1	テブラロキシジム	1:25 – 45:1	1:8 – 15:1	1:3 – 3:1
1	テルバシル	1:288 – 4:1	1:96 – 2:1	1:36 – 1:4
1	テルプチルアジン	1:857 – 2:1	1:285 – 1:3	1:107 – 1:12
1	テルプトリン	1:192 – 6:1	1:64 – 2:1	1:24 – 1:3
1	デニルクロル	1:85 – 14:1	1:28 – 5:1	1:10 – 1:2
1	チアゾビル	1:384 – 3:1	1:128 – 1:1	1:48 – 1:6
1	チエンカルバゾン	1:3 – 336:1	1:1 – 112:1	2:1 – 21:1

10

20

30

40

50



【表 2 0】

成分(a) (化合物番号)	成分(b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
1	チフェンスルフロン-メチル	1:5 - 224:1	1:1 - 75:1	1:1 - 14:1
1	チアフェナシル	1:17 - 68:1	1:5 - 23:1	1:2 - 5:1
1	チオベンカルブ	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	トルピラレート	1:31 - 37:1	1:10 - 13:1	1:3 - 3:1
1	トプラムゾン	1:6 - 168:1	1:2 - 56:1	1:1 - 11:1
1	トラルコキシジム	1:68 - 17:1	1:22 - 6:1	1:8 - 2:1
1	トリアファモン	1:2 - 420:1	1:1 - 140:1	2:1 - 27:1
1	トリアラート	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	トリアスルフロン	1:5 - 224:1	1:1 - 75:1	1:1 - 14:1
1	トリアジフラム	1:171 - 7:1	1:57 - 3:1	1:21 - 1:3
1	トリベヌロン-メチル	1:3 - 336:1	1:1 - 112:1	2:1 - 21:1
1	トリクロピル	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	トリフロキシスルフロン	1:2 - 420:1	1:1 - 140:1	2:1 - 27:1
1	トリフルジモキサジン	1:25 - 45:1	1:8 - 15:1	1:3 - 3:1
1	トリフルラリン	1:288 - 4:1	1:96 - 2:1	1:36 - 1:4
1	トリフルスルフロン-メチル	1:17 - 68:1	1:5 - 23:1	1:2 - 5:1
1	トリトスルフロン	1:13 - 84:1	1:4 - 28:1	1:1 - 6:1

10

20

## 【 0 2 7 7】

表 A 2 は、「成分 ( a )」欄見出しの下項目が、以下に示すそれぞれの成分 ( a ) 欄の項目で置き換えられていることを除き、上記表 A 1 と同様に構成されている。成分 ( a ) 欄の化合物 2 が、索引表 A において特定されている。したがって、例えば、表 A 2 において、「成分 ( a )」欄見出しの下項目は全て「化合物 2」(即ち、索引表 A において特定されている化合物 2) を列挙し、表 A 2 における欄見出しの下第 1 行は、化合物 2 と 2 , 4 - D との混合物を具体的に開示している。

30

## 【 0 2 7 8】

【表 2 1】

表番号	成分(a)欄の項目
A2	化合物 2
A3	化合物 2
A4	化合物 2
A5	化合物 2
A6	化合物 2
A7	化合物 2
A8	化合物 2

40

## 【 0 2 7 9】

望ましくない植生のより良好な防除 (例えば相乗作用 (強化された効果)、防除される雑草の範囲の拡大、または、農作物の安全性の強化などによる使用量の低減) のために、

50

または、抵抗性雑草の発生を防止するために、式 1 の化合物と、クロリムロン - エチル、ニコスルフロン、メソトリオン、チフェンスルフロン - メチル、フルピルスルフロン - メチル、トリベヌロン、ピロキサスルホン、ピノキサデン、テンボトリオン、ピロキシスラム、メトラクロールおよび S - メトラクロールからなる群から選択される除草剤との混合物が好適である。

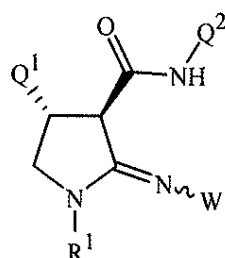
【 0 2 8 0 】

以下の試験は、特定の雑草に対する本発明の化合物の防除効能を実証する。しかしながら、これらの化合物によって得られる雑草防除はこれらの種に限定されない。化合物の説明については索引表 A を参照されたい。以下の索引表において、以下の略語が使用されている： t - B u は t e r - ブチルであり、P h はフェニルを表す。略語「C m p d . N o .」は「化合物番号」を表す。略語「E x .」は「実施例」を表し、どの実施例においてその化合物が製造されているかを示す数字が続いている。索引表 B 中の  $^1\text{H}$  NMR スペクトルは、特に断りのない限り 400 MHz における DMSO- $d_6$  中のテトラメチルシランからの低磁場側の ppm で報告されており；「s」は一重項を意味し、「d」は二重項を意味し、「t」は三重項を意味し、「q」は四重項を意味し、「m」は多重項を意味し、「bs」は広幅一重項を意味する。質量スペクトルデータは、大気圧化学イオン化 (AP+) を用いて観察される、 $\text{H}^+$  (分子量 1) の分子への付加によって形成される親イオン ( $\text{M} + 1$ ) であって、同位体存在度が最も高い親イオンの分子量として、 $\pm 0.5 \text{ Da}$  の推定精度で報告される。

【 0 2 8 1 】

【表 2 2】

索引表 A



化合物番号	R <sup>1</sup>	Q <sup>1</sup>	Q <sup>2</sup>	W	mp (°C)
1(実施例 2)	CH <sub>3</sub>	Ph(4-CF <sub>3</sub> )	Ph(2,3-ジ-F)	-NH(C=O)- <i>t</i> -Bu	240–244 *
2(実施例 1)	CH <sub>3</sub>	Ph(4-CF <sub>3</sub> )	Ph(2,3-ジ-F)	-NH <sub>2</sub>	120–123 *
3	CH <sub>3</sub>	Ph(4-CF <sub>3</sub> )	Ph(2,3-ジ-F)	-NH(Me)	MS ES+ 427
4	CH <sub>3</sub>	Ph(4-CF <sub>3</sub> )	Ph(2,3-ジ-F)	-N(Me) <sub>2</sub>	MS ES+ 441
5	CH <sub>3</sub>	Ph(4-CF <sub>3</sub> )	Ph(2,3-ジ-F)	-NH(C=O)Me	MS ES+ 455
6	CH <sub>3</sub>	Ph(4-CF <sub>3</sub> )	Ph(2,3-ジ-F)	N-ピペリジニル	MS ES+ 481
7	CH <sub>3</sub>	Ph(4-CF <sub>3</sub> )	Ph(2,3-ジ-F)	N-モルホリニル	MS ES+ 483
8	CH <sub>3</sub>	Ph(4-CF <sub>3</sub> )	Ph(2,3-ジ-F)	-NH(C=O)O- <i>t</i> -Bu	MS ES+ 513

\* $^1\text{H}$  NMR データについては、合成例を参照されたい。

\*\* $^1\text{H}$  NMR データについては、索引表 B を参照されたい。

【 0 2 8 2 】

## 【表 2 3】

## 索引表 B

化合物 番号	<sup>1</sup> H NMR データ	
3	δ 10.66 (s, 1H), 10.31 (s, 1H), 7.80–7.78 (m, 2H), 7.69–7.67 (m, 2H), 7.59–7.56 (m, 1H), 7.26–7.17 (m, 2H), 4.61 (d, 1H), 4.21–4.18 (m, 1H), 4.02 (m, 1H), 3.93–3.89 (m, 1H), 3.13 (s, 3H), 2.48–2.47 (m, 3H).	
4	δ (CDCl <sub>3</sub> ) 12.05 (s, 1H), 8.15–8.12 (m, 1H), 7.58–7.57 (m, 2H), 7.31–7.30 (m, 2H), 7.07–7.02 (m, 1H), 6.90–6.84 (m, 1H), 4.28–4.26 (m, 1H), 4.02–3.99 (m, 2H), 3.26–3.24 (m, 1H), 2.94 (s, 3H), 2.50 (bs, 6H).	10
5	δ 10.13 (s, 1H), 9.54 (s, 1H), 7.72–7.70 (m, 2H), 7.61–7.55 (m, 3H), 7.22–7.16 (m, 2H), 3.98–3.96 (m, 1H), 3.86–3.83 (m, 1H), 3.76–3.73 (m, 1H), 3.40–3.37 (m, 1H), 2.87 (s, 3H), 1.71 (s, 3H).	
8	δ 9.98 (s, 1H), 8.41, (bs, 1H), 7.74–7.70 (m, 3H), 7.58–7.57 (m, 2H), 7.21–7.15 (m, 2H), 4.20–4.19 (m, 1H), 3.83–3.79 (m, 2H), 3.36–3.35 (m, 1H), 2.84 (s, 3H), 1.26 (s, 9H).	20

## 【0 2 8 3】

## 本発明の生物学的実施例

## 試験 A

イヌビエ (エチノクロア・クルス - ガルリ (*Echinochloa crus-galli*))、ホウキギ (コチア・スコパリア (*Kochia scoparia*))、ブタクサ (common ragweed、アンプロシア・エラチオル (*Ambrosia elatior*))、イタリアンライグラス (*Italian ryegrass*、ロリウム・マルチフロラム (*Lolium multiflorum*))、エノコログサ (green foxtail、セタリア・ヴィリディス (*Setaria viridis*))、およびアカザ (アマランサス・レトロフレックス (*Amaranthus retroflexus*)) から選択される植物種の種子をローム土壌と砂とのブレンドに蒔き、界面活性剤を含む非植物毒性溶媒混合物に配合した試験化学物質を用いて直接土壌噴霧で発生前処理した。

## 【0 2 8 4】

同時に、これら雑草種、ならびに、コムギ (トリチウム・アエスティBUM (*Triticum aestivum*))、コーン (ゼア・マイズ (*Zea mays*))、ブラックグラス (アロペクルス・ミオスロイデス (*Alopecurus myosuroides*)) およびヤエムグラ (catchweed bedstraw、ガリウム・アパリネ (*Galium aparine*)) から選択される植物を同一のローム土壌と砂とのブレンドを含有するポットに植え、同様に配合した試験化学物質の発生後適用で処理した。発生後処理に関して、植物は、2 ~ 10 cm の範囲の高さであり、1 ~ 2 葉展開期のものではあった。処理した植物および未処理の対照を温室中におよそ 10 日間維持し、その後、全ての処理した植物を未処理の対照と比較し、被害について視覚的に評価した。表 A にまとめられている植物の応答評価は 0 ~ 100 スケールに基づいており、ここで、0 は効果無しであり、100 は完全な防除である。ダッシュ記号 ( - ) による応答は、試験結果が得られなかったことを意味する。

## 【0 2 8 5】

【表 2 4】

表 A	化合物						
125 g ai/ha	1	2	3	4	5	7	8
発生後							
イヌビエ	80	60	70	60	80	50	80
ブラックグラス	50	30	80	50	80	30	60
コーン	40	10	30	20	40	0	70
アキノエノコログサ	-	-	70	80	80	50	80
エノコログサ	80	70	-	-	-	-	-
ヤエムグラ	10	60	80	70	80	70	70
ハウキギ	0	0	60	40	30	60	0
アカザ	0	40	90	70	80	60	40
ブタクサ	0	0	50	30	0	50	0
イタリアンライグラス	60	30	40	20	80	30	60
コムギ	30	0	30	20	50	10	40

10

表 A	化合物						
31 g ai/ha	1	2	3	4	5	7	8
発生後							
イヌビエ	40	20	60	0	60	0	60
ブラックグラス	10	0	40	30	60	30	30
コーン	0	10	20	0	0	0	20
アキノエノコログサ	-	-	40	0	70	0	50
エノコログサ	40	30	-	-	-	-	-
ヤエムグラ	0	60	60	60	70	60	60
ハウキギ	0	0	20	0	20	0	0
アカザ	0	0	0	0	30	0	30
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0
イタリアンライグラス	20	0	0	0	10	10	10
コムギ	0	0	0	0	0	0	0

20

30

表 A	化合物						
125 g ai/ha	1	2	3	4	5	7	8
発生前							
イヌビエ	100	90	90	90	90	50	90
アキノエノコログサ	-	-	90	90	90	90	90
エノコログサ	100	100	-	-	-	-	-

40

50

【表 2 5】

ホウキギ	60	60	30	30	90	20	80
アカザ	90	80	70	60	80	10	80
ブタクサ	100	40	0	0	70	0	20
イタリアンライグラス	0	0	90	10	90	0	70

表 A

化合物

31 g ai/ha

1 2 3 4 5 7 8

発生前

イヌビエ	80	70	30	50	90	10	90
アキノエノコログサ	-	-	70	50	90	50	90
エノコログサ	50	70	-	-	-	-	-
ホウキギ	0	0	0	0	10	0	20
アカザ	50	0	0	0	70	0	30
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	-
イタリアンライグラス	0	0	0	0	20	0	20

10

20

【0286】

## 試験 B

イネ（オリザ・サティバ（*Oryza sativa*））、タマガヤツリ（small-flower umbrella sedge）、シペラス・ディフォルミス（*Cyperus difformis*）、アメリカコナギ（ヘテランテラ・リモサ（*Heteranthera limosa*））、およびイヌビエ（エチノクロア・クルス - ガルリ（*Echinochloa crus-galli*））から選択される、冠水させた水田試験における植物種を試験のために2葉展開期まで成長させた。処理時に、試験ポットを土壌表面より3cm上まで冠水させ、試験化合物を田面水に直接施用することにより処理し、次いで、この水深を試験期間中維持した。処理した植物および対照を温室中に13～15日間維持し、その後、全ての種を対照と比較し、視覚的に評価した。表Bにまとめられている植物の応答評価は0～100のスケールに基づいており、ここで、0は効果無しであり、100は完全な防除である。ダッシュ記号（-）による応答は、試験結果が得られなかったことを意味する。

30

【0287】

【表 2 6】

表 B

化合物

250 g ai/ha

1 2 3 4 5 7 8 9

冠水

イヌビエ	65	40	70	55	45	10	75	75
アメリカコナギ	30	0	100	75	65	45	60	100
イネ	0	0	0	0	0	0	0	0
タマガヤツリ	0	50	0	0	0	0	0	0

40

50

## フロントページの続き

(51)国際特許分類

F I

**A 0 1 P 13/00 (2006.01)**

A 0 1 P

13/00

(56)参考文献

国際公開第 2 0 1 6 / 0 0 3 9 9 7 ( W O , A 1 )

国際公開第 2 0 1 6 / 1 9 6 5 9 3 ( W O , A 1 )

国際公開第 2 0 1 6 / 1 6 4 2 0 1 ( W O , A 1 )

特表 2 0 1 7 - 5 0 6 2 1 0 ( J P , A )

国際公開第 2 0 1 6 / 1 9 6 0 1 9 ( W O , A 1 )

(58)調査した分野 (Int.Cl., D B 名)

C 0 7 D

A 0 1 N

A 0 1 P

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