

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

(11)公表番号
特表2025-506046
(P2025-506046A)

(43)公表日 令和7年3月5日(2025.3.5)

(51)国際特許分類	F I	テーマコード (参考)
C 0 7 D 215/48 (2006.01)	C 0 7 D 215/48	C S P 4 H 0 1 1
A 0 1 P 13/00 (2006.01)	A 0 1 P 13/00	
A 0 1 N 43/42 (2006.01)	A 0 1 N 43/42	1 0 1
A 0 1 N 47/02 (2006.01)	A 0 1 N 47/02	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全51頁)

(21)出願番号	特願2024-547664(P2024-547664)	(71)出願人	520222106 シンジェンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト スイス 4 0 5 8 バーゼル ローゼンタ ールシュトラッセ 6 7
(86)(22)出願日	令和5年2月13日(2023.2.13)	(74)代理人	100103610 弁理士 ▲吉▼田 和彦
(85)翻訳文提出日	令和6年8月13日(2024.8.13)	(74)代理人	100109070 弁理士 須田 洋之
(86)国際出願番号	PCT/EP2023/053441	(74)代理人	100119013 弁理士 山崎 一夫
(87)国際公開番号	WO2023/156323	(74)代理人	100111796 弁理士 服部 博信
(87)国際公開日	令和5年8月24日(2023.8.24)	(74)代理人	100123766 弁理士 松田 七重
(31)優先権主張番号	22157289.4		
(32)優先日	令和4年2月17日(2022.2.17)		
(33)優先権主張国・地域又は機関	欧州特許庁(EP)		
(81)指定国・地域	AP(BW,CV,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV		

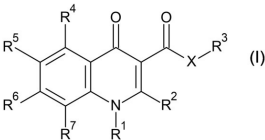
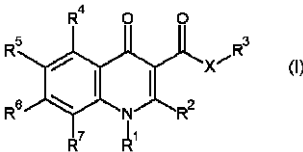
最終頁に続く

最終頁に続く

(54)【発明の名称】 除草性キノロン誘導体

(57)【要約】

置換基は請求項1に定義されているとおりである、式（Ⅰ）の化合物。本発明はさらに、式（Ⅰ）の化合物を含む除草組成物、及び、特に有用な植物の作物における、雑草を防除するための式（Ⅰ）の化合物の使用に関する。

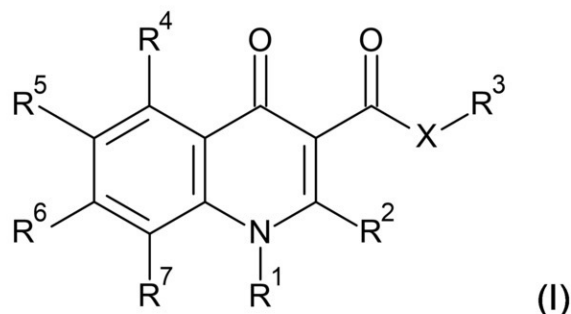


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



10

(式中、

X は、O であり；

R^1 は、 R^{10} により表される同一であっても若しくは異なってもよい 1 個若しくは 2 個の基で任意に置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル又はフェニルであり；

R^2 は、水素、フェニル又はヘテロアリールであり、ここで、前記ヘテロアリール部分は、N、O 及び S から個々に選択される 1 個、2 個、3 個若しくは 4 個のヘテロ原子を含む 5 員若しくは 6 員芳香族環であり、ここで、各フェニル及びヘテロアリール部分は、 R^8 により表される同一であっても若しくは異なってもよい 1 個、2 個、3 個若しくは 4 個の基で任意に置換されていてもよく；

20

R^3 は、水素又は $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、及びフェニルからそれぞれ独立に選択され、ここで、各フェニル部分は、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい 1 個、2 個、3 個若しくは 4 個の基で任意に置換されていてもよく；

30

R^8 は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノカルボニル、又は N、N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) アミノカルボニルであり；

40

R^9 は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノカルボニル、又は N、N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) アミノカルボニルであり；

R^{10} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、又は $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルである)

の化合物、又はその塩若しくは N-オキシド。

【請求項 2】

50

R^1 が、 R^{10} により表される単一の基で任意に置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルキル又はフェニルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R^2 は、水素であるか、又は R^8 により表される同一であっても異なってもよい1又は2個の基で置換されているフェニルである、請求項1又は請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

R^2 が、 R^8 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個若しくは2個の基で置換されているフェニルである、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項5】

R^3 が、水素である、請求項1～4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

R^5 が、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分が、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個若しくは2個の基で任意に置換されていてもよい、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項7】

R^4 、 R^6 、及び R^7 が水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルからそれぞれ独立に選択されるとき、 R^5 が、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、前記フェニル部分が、単一の R^9 基で任意に置換されていてもよい、請求項1～6のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項8】

R^4 が、水素、ハロゲン、シアノ、アセチル、又はトリフルオロメチルである、請求項1～7のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項9】

R^8 が、ハロゲンである、請求項1～8のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項10】

Xが、Oであり；

R^1 が、エチル又は4-トリフルオロメトキシフェニルであり；

R^2 が、水素、3,4-ジクロロフェニル又は4-フルオロフェニルであり；

R^3 が、水素であり；

R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 が、水素、ハロゲン、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、アミノカルボニル、及び4-フルオロフェニルからそれぞれ独立に選択される、請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項11】

請求項1～10のいずれか一項に記載の化合物及び農学的に許容可能な配合補助剤を含む除草組成物。

【請求項12】

少なくとも1種の追加の殺有害生物剤をさらに含む、請求項11に記載の除草組成物。

【請求項13】

前記追加の殺有害生物剤は、除草剤又は除草剤毒性緩和剤である、請求項12に記載の除草組成物。

【請求項14】

不要な植物の成長を防除する方法であって、請求項1～10のいずれか一項に記載の式(I)の化合物、又は、請求項11～13のいずれか一項に記載の除草組成物を、前記不

10

20

30

40

50

要な植物若しくはその生息地に適用するステップを含む方法。

【請求項 15】

除草剤としての、請求項 1～10 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、例えば除草性活性を有する有効成分としての除草性キノロン誘導体に関する。本発明はまた、少なくとも 1 種のキノロン誘導体を含む農薬組成物、これら化合物の調製プロセス、及び、特に有用な植物の作物における、農業又は園芸における雑草の防除におけるキノロン誘導体又は組成物の使用に関する。

10

【背景技術】

【0002】

米国特許第 4,670,444 号明細書、Med Chem Res (2016) 25, 1861-1876、及び J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1, 2002, 1232-1235 は、抗菌剤としてのキノロン誘導体について記載している。これに加えて、CN108617661 号明細書及び CN101643468 号明細書は、農業用薬剤としてのキノロン誘導体の使用、例えば、殺虫剤、殺菌剤、又は除草剤としての使用について開示している。さらに、Chem. Commun., 2018, 54, 1869 は、除草性活性を有するフルオロキノロン類似体について開示している。

20

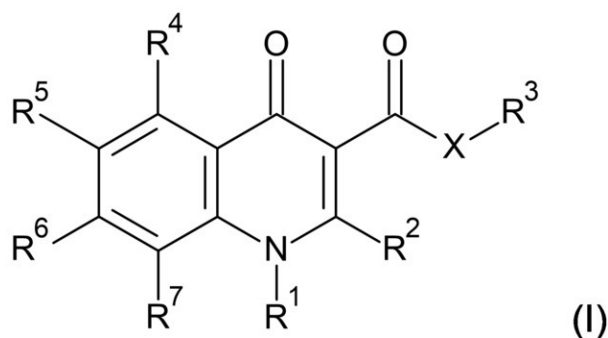
【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0003】

本発明によれば、式 (I)：

【化 1】



30

(式中、

X は、O であり；

R¹ は、R¹⁰ により表される同一であっても若しくは異なってもよい 1 個若しくは 2 個の基で任意に置換されていてもよい C₁～C₆ アルキル又はフェニルであり；

R² は、水素、フェニル又はヘテロアリールであり、ヘテロアリール部分は、N、O 及び S から個々に選択される 1、2、3 又は 4 個のヘテロ原子を含む 5 員若しくは 6 員芳香族環であり、並びに、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R⁸ により表される同一であっても異なってもよい 1、2、3 又は 4 個の基で任意に置換されていてもよく；

40

R³ は、水素又は C₁～C₆ アルキルであり；

R⁴、R⁵、R⁶、及び R⁷ は、水素、ハロゲン、シアノ、C₁～C₆ アルキル、C₁～C₆ アルコキシ、C₁～C₆ ハロアルキル、C₁～C₆ ハロアルコキシ、C₁～C₆ アルキルカルボニル、C₁～C₆ アルキルスルファニル、C₁～C₆ アルキルスルフィニル、C₁～C₆ アルキルスルホニル、C₁～C₆ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、及びフェニルからそれぞれ独立に選択され、ここで、各フェニル部分は、R⁹ により表される同一であっても若しくは異なってもよい 1 個、2 個、3 個若しくは 4 個の基で任意に置換さ

50

れていてもよく；

R^8 は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノカルボニル、又はN，N-ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）アミノカルボニルであり；

R^9 は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノカルボニル、又はN，N-ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）アミノカルボニルであり；

R^{10} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、又は $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルである）

の化合物、又はその塩若しくはN-オキシドを提供する。

【0004】

意外なことに、式（I）の新規化合物は、実用的な目的について、きわめて有利なレベルの除草性活性を有することが見出された。

【0005】

本発明の第2の態様によれば、除草性有効量の本発明に係る式（I）の化合物を含む農業組成物が提供される。このような農業組成物は、少なくとも1種の追加の有効成分及び／又は農芸化学的に許容可能な希釈剤若しくはキャリアをさらに含んでいてもよい。

【0006】

本発明の第3の態様によれば、生息地において雑草を防除する方法であって、生息地に、雑草防除量の式（I）の化合物を含む組成物を適用するステップを含む方法が提供される。

【0007】

本発明の第4の態様によれば、除草剤としての式（I）の化合物の使用が提供される。

【発明を実施するための形態】

【0008】

置換基が「任意に置換されていてもよい」と記載されている場合、これは、1個以上の同等又は異なる置換基、例えば、1個、2個又は3個の R^8 置換基を有していても有していなくてもよいことを意味する。例えば、1、2又は3個のハロゲンにより置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキルとしては、特に限定されないが、 $-CH_2Cl$ 、 $-CHCl_2$ 、 $-CCl_3$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-CH_2CF_3$ 又は $-CF_2CH_3$ 基が挙げられ得る。他の例として、1、2又は3個のハロゲンにより置換されている $C_1 \sim C_6$ アルコキシとしては、特にこれらに限定されないが、 CH_2ClO- 、 $CHCl_2O-$ 、 CCl_3O- 、 CH_2FO- 、 CHF_2O- 、 CF_3O- 、 CF_3CH_2O- 又は CH_3CF_2O- 基が挙げられ得る。

【0009】

本明細書において使用する場合、「シアノ」という用語は、 $-CN$ 基を意味する。

【0010】

本明細書において使用する場合、「ハロゲン」という用語は、フッ素（フルオロ）、塩素（クロロ）、臭素（ブロモ）又はヨウ素（ヨード）を指す。

【0011】

本明細書において使用する場合、「ニトロ」という用語は、 $-NO_2$ 基を意味する。

10

20

30

40

50

【0012】

本明細書において使用する場合、「 $C_1 \sim C_6$ アルキル」という用語は、炭素及び水素原子のみから構成され、不飽和を含まず、1～6個の炭素原子を有し、並びに、単結合によって分子の残部に結合している直鎖又は分岐鎖炭化水素鎖基を指す。「 $C_1 \sim C_4$ アルキル」及び「 $C_1 \sim C_3$ アルキル」も同様に解釈されるべきである。 $C_1 \sim C_6$ アルキルの例としては、これらに限定されないが、メチル、エチル、 n -プロピル、及び、その異性体、例えば、イソプロピルが挙げられる。「 $C_1 \sim C_6$ アルキレン」基は $C_1 \sim C_6$ アルキルの対応する定義を指すが、ただし、このような基は、2つの単結合によって分子の残部に結合していることを除く。「 $C_1 \sim C_2$ アルキレン」という用語も同様に解釈されるべきである。 $C_1 \sim C_6$ アルキレンの例としては、これらに限定されないが、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 及び $-(CH_2)_3-$ が挙げられる。

10

【0013】

本明細書において使用する場合、「 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル」という用語は、1つ以上の同一又は異なるハロゲン原子により置換されている、一般的に上記に定義されている $C_1 \sim C_6$ アルキル基を指す。「 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル」及び「 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル」という用語も同様に解釈されるべきである。 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルの例としては、これらに限定されないが、トリフルオロメチルが挙げられる。

【0014】

本明細書において使用する場合、「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ」という用語は、 R_a が一般的に上記に定義されている $C_1 \sim C_6$ アルキル基である式 $-OR_a$ の基を指す。「 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ」及び「 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ」という用語も同様に解釈されるべきである。 $C_1 \sim C_6$ アルコキシの例としては、これらに限定されないが、メトキシ、エトキシ、1-メチルエトキシ（イソプロポキシ）及びプロポキシが挙げられる。

20

【0015】

本明細書において使用する場合、「 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ」という用語は、1つ以上の同一又は異なるハロゲン原子により置換されている、一般的に上記に定義されている $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基を指す。「 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ」及び「 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ」という用語も同様に解釈されるべきである。 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシの例としては、これらに限定されないが、トリフルオロメトキシが挙げられる。

【0016】

本明細書において使用する場合、「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル」という用語は、 R_b が一般的に上記に定義されている $C_1 \sim C_6$ アルキル基であり、及び、 R_a が一般的に上記に定義されている $C_1 \sim C_6$ アルキレン基である式 R_bOR_a- の基を指す。

30

【0017】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル」は、式 $-C(O)OR_a$ の基（式中、 R_a は、上記で一般に定義するような $C_1 \sim C_6$ アルキル基である）を指す。

【0018】

本明細書において使用する場合、「 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル」という用語は、単環式飽和環系であり、及び、3～6個の炭素原子を含有する基を指す。「 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル」及び「 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル」という用語も同様に解釈されるべきである。 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルの例としては、これらに限定されないが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシルが挙げられる。

40

【0019】

本明細書において使用する場合、「ヘテロアリール」という用語は、窒素、酸素及び硫黄から個々に選択される1、2、3又は4個のヘテロ原子を含む5又は6員芳香族単環式環基を指す。ヘテロアリールの例としては、これらに限定されないが、フラニル、ピロリル、チエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ピラジニル、ピリダジニル、ピリミジル又はピリジルが挙げられる。

50

【0020】

本明細書において使用する場合、「 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル」という用語は、 R_a が一般的に上記に定義されている $C_1 \sim C_6$ アルキル基である式 $-C(O)R_a$ の基を指す。 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルの例としては、これらに限定されないが、アセチルが挙げられる。

【0021】

本明細書において使用する場合、「 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル」という用語は、 R_a が一般的に上記に定義されている $C_1 \sim C_6$ アルキル基である式 $-SR_a$ の基を指す。「 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル」及び「 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルファニル」という用語も同様に解釈されるべきである。 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニルの例としては、これらに限定されないが、メチルスルファニルが挙げられる。

10

【0022】

本明細書において使用する場合、「 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル」という用語は、 R_a が一般的に上記に定義されている $C_1 \sim C_6$ アルキル基である式 $-S(O)R_a$ の基を指す。「 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル」及び「 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニル」という用語も同様に解釈されるべきである。 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニルの例としては、これらに限定されないが、メチルスルフィニルが挙げられる。

【0023】

本明細書において使用する場合、「 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル」という用語は、 R_a が一般的に上記に定義されている $C_1 \sim C_6$ アルキル基である式 $-S(O)_2R_a$ の基を指す。「 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル」及び「 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル」という用語も同様に解釈されるべきである。 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル (alkylsulfonyl) の例としては、これらに限定されないが、メチルスルホニルが挙げられる。

20

【0024】

本明細書において使用する場合、「 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホンアミド」という用語は、式 $-NHS(O)_2R_a$ の基を指し、 R_a は一般的に上記に定義されている $C_1 \sim C_6$ アルキル基である。

【0025】

本明細書において使用する場合、用語「アミノカルボニル」は、式 $-C(O)NH_2$ の基を指す。

30

【0026】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル」は、式 $-C(O)NHR_a$ の基 (式中、 R_a は、上記で一般に定義するような $C_1 \sim C_6$ アルキル基である) を指す。

【0027】

本明細書において使用する場合、用語「N, N-ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) アミノカルボニル」は、式 $-C(O)N(R_a)(R_b)$ の基を指し、式中、 R_a 及び R_b は、それぞれ個々に、上記で一般に定義するような $C_1 \sim C_4$ アルキル基である。用語「N, N-ジ ($C_1 \sim C_3$ アルキル) アミノカルボニル」は、同様に解釈されるべきである。

【0028】

本明細書において使用する場合、用語「 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノカルボニル」は、 $-NHC(O)-$ リンカーを介して分子の残部に付着している $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル環を指す。

40

【0029】

1つ以上の可能なステレオジエン要素が式(I)の化合物に存在する、とは、その化合物が光学異性形態、すなわち、鏡像異性形態又はジアステレオ異性形態をとり得ることを意味する。また、アトロプ異性体は、単結合に係る回転の制限によって生じ得る。式(I)は、すべてのこれらの可能性のある異性形態及びその混合物を含むことが意図されている。本発明は、式(I)の化合物に係るすべてのこれらの可能性のある異性形態及びその混合物を含む。同様に、式(I)は、すべての可能性のある互変異性体を含むことが意図

50

されている。本発明は、式 (I) の化合物に係るすべての可能性のある互変異性形態を含む。

【0030】

各事例において、本発明に係る式 (I) の化合物は、遊離形態、又は、塩形態、例えば農学的に使用可能な塩形態である。式 (I) の化合物が、第一級、第二級及び第三級アミン（例えばアンモニア、ジメチルアミン及びトリエチルアミン）を含むアミン、アルカリ金属及びアルカリ土類金属塩基、遷移金属又は第四級アンモニウム塩基と形成し得る塩が好ましい。

【0031】

以下のリストは、式 (I) の化合物を参照して、置換基 X 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 及び R^{10} に係る定義（好ましい定義を含む）を提供する。これらの置換基のいずれか1つについて、以下に記載の定義のいずれかは、本書面中以下又は他の箇所に記載されている、いずれかの他の置換基のいずれかの定義と組み合わせられ得る。

10

【0032】

X は、 O である。

【0033】

R^1 は、 R^{10} により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個若しくは2個の基で任意に置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル又はフェニルである。好ましくは、 R^1 は、 R^{10} により表される単一の基で任意に置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル又はフェニルである。より好ましくは、 R^1 は、 R^{10} により表される単一の基で任意に置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルキル又はフェニルである。さらにより好ましくは、 R^1 は、エチル又は4-トリフルオロメトキシフェニルである。一実施形態において、 R^1 は、エチルである。

20

【0034】

実施形態の1つの組において、 R^1 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである。好ましくは、 R^1 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルである。より好ましくは、 R^1 は、 $C_1 \sim C_3$ アルキルである。さらにより好ましくは、 R^1 は、メチル、エチル、 n -プロピル、又はイソプロピルである。さらにより好ましくは、 R^1 は、メチル又はエチルである。最も好ましくは、 R^1 は、エチルである。

【0035】

R^2 は、水素、フェニル又はヘテロアリールであり、ヘテロアリール部分は、 N 、 O 及び S から個々に選択される1、2、3又は4個のヘテロ原子を含む5員若しくは6員芳香族環であり、並びに、各フェニル及びヘテロアリール部分は、 R^8 により表される同一であっても異なってもよい1、2、3又は4個の基で任意に置換されていてもよい。

30

【0036】

好ましくは、 R^2 は、水素、フェニル又はヘテロアリールであり、ここで、ヘテロアリール部分は、 N 、 O 及び S から個々に選択される1個、2個若しくは3個のヘテロ原子を含む5員若しくは6員芳香族環であり、ここで、各フェニル及びヘテロアリール部分は、 R^8 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個、2個若しくは3個の基で任意に置換されていてもよい。

40

【0037】

より好ましくは、 R^2 は、水素、フェニル又はヘテロアリールであり、ここで、ヘテロアリール部分は、 N 及び O から個々に選択される1個若しくは2個のヘテロ原子を含む5員若しくは6員芳香族環であり、ここで、各フェニル及びヘテロアリール部分は、 R^8 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個、2個若しくは3個の基で任意に置換されていてもよい。

【0038】

さらにより好ましくは、 R^2 は、水素、フェニル又はヘテロアリールであり、ここで、ヘテロアリール部分は、 N 及び O から個々に選択される1個若しくは2個のヘテロ原子を含む5員若しくは6員芳香族環であり、ここで、各フェニル及びヘテロアリール部分は、

50

R^8 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個若しくは2個の基で任意に置換されていてもよい。

【0039】

さらにより好ましくは、 R^2 は、水素、又は R^8 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個若しくは2個の基で置換されているフェニルである。実施形態の1つの組において、 R^2 は、水素、3, 4-ジクロロフェニル、3-クロロ-4-シアノフェニル、4-クロロ-3-シアノフェニル、4-クロロ-3-フルオロフェニル、又は4-フルオロフェニルである。実施形態の好ましい組において、 R^2 は、水素、3, 4-ジクロロフェニル又は4-フルオロフェニルである。

【0040】

実施形態の1つの組において、 R^2 は、フェニル又はヘテロアリールであり、ここで、ヘテロアリール部分は、N、O及びSから個々に選択される1個、2個、3個若しくは4個のヘテロ原子を含む5員若しくは6員芳香族環であり、ここで、各フェニル及びヘテロアリール部分は、 R^8 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個、2個、3個若しくは4個の基で任意に置換されていてもよい。

【0041】

好ましくは、 R^2 はフェニル又はヘテロアリール（ここで、ヘテロアリール部分は、N、O及びSから個々に選択される1、2又は3個のヘテロ原子を含む5員若しくは6員芳香族環である）であり、各フェニル及びヘテロアリール部分は、 R^8 により表される同一であっても異なってもよい1、2又は3個の基で任意に置換されていてもよい。

【0042】

より好ましくは、 R^2 はフェニル又はヘテロアリール（ここで、ヘテロアリール部分は、N及びOから個々に選択される1又は2個のヘテロ原子を含む5員若しくは6員芳香族環である）であり、各フェニル及びヘテロアリール部分は、 R^8 により表される同一であっても異なってもよい1、2又は3個の基で任意に置換されていてもよい。

【0043】

さらにより好ましくは、 R^2 はフェニル又はヘテロアリール（ここで、ヘテロアリール部分は、N及びOから個々に選択される1又は2個のヘテロ原子を含む5員若しくは6員芳香族環である）であり、各フェニル及びヘテロアリール部分は、 R^8 により表される同一であっても異なってもよい1又は2個の基で任意に置換されていてもよい。

【0044】

さらにより好ましくは、 R^2 は、 R^8 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個若しくは2個の基で任意に置換されていてもよいフェニルである。さらにより好ましくは、 R^2 は、 R^8 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個若しくは2個の基で置換されているフェニルである。実施形態の1つの組において、 R^2 は、3, 4-ジクロロフェニル、3-クロロ-4-シアノフェニル、4-クロロ-3-シアノフェニル、4-クロロ-3-フルオロフェニル、又は4-フルオロフェニルである。実施形態の好ましい組において、 R^2 は、3, 4-ジクロロフェニル又は4-フルオロフェニルである。好ましくは、 R^2 は、3, 4-ジクロロフェニルである。

【0045】

R^3 は、水素又は $C_1 \sim C_6$ アルキルである。好ましくは、 R^3 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキル、より好ましくは、水素又は $C_1 \sim C_3$ アルキルである。さらにより好ましくは、 R^3 は、水素、メチル、又はエチルである。さらにより好ましくは、 R^3 は、水素である。

【0046】

R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、及びフェニルからそれぞれ独立に選択され、ここで、各フェニル部分は、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個、2個、3個若しくは4個の基で任意に置換

10

20

30

40

50

されていてもよい。

【0047】

好ましくは、 R^4 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分は、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個、2個、3個若しくは4個の基で任意に置換されていてもよい。

【0048】

より好ましくは、 R^4 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分は、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個、2個若しくは3個の基で任意に置換されていてもよい。

10

【0049】

さらに好ましくは、 R^4 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分は、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個若しくは2個の基で任意に置換されていてもよい。

20

【0050】

さらに好ましくは、 R^4 は、水素、ハロゲン、シアノ、アセチル、又は $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルである。実施形態の別の組において、 R^4 は、水素、ハロゲン、シアノ、アセチル、又はトリフルオロメチルである。実施形態のさらなる組において、 R^4 は、水素、クロロ、ブromo、シアノ、アセチル、又はトリフルオロメチルである。

【0051】

実施形態の1つの組において、 R^4 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分は、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個、2個、3個若しくは4個の基で任意に置換されていてもよい。

30

【0052】

好ましくは、 R^4 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分は、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個、2個若しくは3個の基で任意に置換されていてもよい。

40

【0053】

より好ましくは、 R^4 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分は、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個若しくは2個の基で任意に置換されていてもよい。

【0054】

実施形態の1つの組において、 R^4 は、水素、ハロゲン、シアノ、又は $C_1 \sim C_3$ ハロア

50

ルキルである。実施形態の別の組において、 R^4 は、水素、ハロゲン、シアノ、又はトリフルオロメチルである。実施形態のさらなる組において、 R^4 は、水素、クロロ、ブロモ、シアノ、又はトリフルオロメチルである。

【0055】

R^5 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分は、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個、2個、3個若しくは4個の基で任意に置換されていてもよい。

10

【0056】

好ましくは、 R^5 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分は、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個、2個若しくは3個の基で任意に置換されていてもよい。

【0057】

より好ましくは、 R^5 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分は、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個若しくは2個の基で任意に置換されていてもよい。

20

【0058】

実施形態の1つの組において、 R^5 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分は、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個若しくは2個の基で任意に置換されていてもよい。実施形態の好ましい組において、 R^5 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分は、単一の R^9 基で任意に置換されていてもよい。実施形態の特に好ましい組において、 R^5 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分は、単一の R^9 基で任意に置換されていてもよい。実施形態のさらにより好ましい組において、 R^5 は、水素、クロロ、フルオロ、ブロモ、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、アミノカルボニル、又は4-フルオロフェニルである。

30

40

【0059】

R^6 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分は、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個、2個、3個若しくは4個の基で任意に置換されていてもよい。

【0060】

好ましくは、 R^6 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニ

50

ル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分は、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個、2個若しくは3個の基で任意に置換されていてもよい。

【0061】

より好ましくは、 R^6 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分は、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個若しくは2個の基で任意に置換されていてもよい。

10

【0062】

実施形態の1つの組において、 R^6 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、又は $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルである。実施形態の別の組において、 R^6 は、水素、ハロゲン、シアノ、メトキシ、又はトリフルオロメチルである。実施形態のさらなる組において、 R^6 は、水素、クロロ、シアノ、メトキシ、又はトリフルオロメチルである。

【0063】

R^7 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分は、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個、2個、3個若しくは4個の基で任意に置換されていてもよい。

20

【0064】

好ましくは、 R^7 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分は、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個、2個若しくは3個の基で任意に置換されていてもよい。

30

【0065】

より好ましくは、 R^7 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルアミノカルボニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、各フェニル部分は、 R^9 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個若しくは2個の基で任意に置換されていてもよい。

【0066】

実施形態の1つの組において、 R^7 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、又は $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルである。実施形態の好ましい組において、 R^7 は、水素である。

40

【0067】

実施形態の1つの組において、 R^4 、 R^6 、及び R^7 が水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルからそれぞれ独立に選択されるとき、 R^5 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、フェニル部分は、単一の R^9 基で任意に置換されていてもよい。実施形態の別の組において、 R^4 、 R^6 、及び R^7 が水素、ハロゲン、シアノ、メトキシ、及びトリフルオロメチルからそれぞれ独立に選択されるとき、 R^5 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル

50

、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル、アミノカルボニル、又はフェニルであり、ここで、フェニル部分は、単一の R^9 基で任意に置換されていてもよい。

【0068】

R^8 は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノカルボニル、又はN，N-ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）アミノカルボニルである。

10

【0069】

好ましくは、 R^8 は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノカルボニル、又はN，N-ジ（ $C_1 \sim C_3$ アルキル）アミノカルボニルである。

20

【0070】

より好ましくは、 R^8 は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim C_3$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルアミノカルボニル、又はN，N-ジ（ $C_1 \sim C_2$ アルキル）アミノカルボニルである。

【0071】

実施形態の好ましい組において、 R^8 は、シアノ又はハロゲンである。実施形態の特に好ましい組において、 R^8 は、ハロゲン、好ましくは、クロロ又はフルオロである。最も好ましくは、 R^8 は、フルオロである。

30

【0072】

R^9 は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノカルボニル又はN，N-ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）アミノカルボニルである。

【0073】

好ましくは、 R^9 は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルアミノカルボニル又はN，N-ジ（ $C_1 \sim C_3$ アルキル）アミノカルボニルである。

40

【0074】

より好ましくは、 R^9 は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ C

50

$C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim C_3$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルアミノカルボニル又はN、N-ジ ($C_1 \sim C_2$ アルキル) アミノカルボニルである。

【0075】

実施形態の好ましい組において、 R^9 は、ハロゲンである。実施形態の特に好ましい組において、 R^9 は、クロロ、フルオロ、又はブromo、好ましくは、フルオロである。

【0076】

R^{10} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、又は $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルである。好ましくは、 R^{10} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルファニル、又は $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニルである。より好ましくは、 R^{10} は、ハロゲン、シアノ、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、メチルスルファニル、又はメチルスルホニルである。さらにより好ましくは、 R^{10} は、トリフルオロメトキシである。

【0077】

本発明による式(I)の化合物において、好ましくは：

Xは、Oであり；

R^1 は、 R^{10} により表される単一の基で置換されているエチル又はフェニルであり；

R^2 は、水素、又は R^8 により表される同一であっても若しくは異なってもよい1個若しくは2個の基で置換されているフェニルであり；

R^3 は、水素であり；

R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 は、水素、ハロゲン、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、アミノカルボニル、及び4-フルオロフェニルからそれぞれ独立に選択され；

R^8 は、ハロゲンであり；

R^{10} は、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシである。

【0078】

一実施形態において、本発明による式(I)の化合物において、好ましくは：

Xは、Oであり；

R^1 は、エチル又は4-トリフルオロメトキシフェニルであり；

R^2 は、水素、3, 4-ジクロロフェニル又は4-フルオロフェニルであり；

R^3 は、水素であり；

R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 は、水素、ハロゲン、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、アミノカルボニル、及び4-フルオロフェニルからそれぞれ独立に選択される。

【0079】

一実施形態において、本発明による式(I)の化合物において、好ましくは：

Xは、Oであり；

R^1 は、エチル又は4-トリフルオロメトキシフェニルであり；

R^2 は、水素、3, 4-ジクロロフェニル又は4-フルオロフェニルであり；

R^3 は、水素であり；

R^4 は、水素、ハロゲン、シアノ、又はトリフルオロメチルであり；

R^5 は、水素、ハロゲン、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、アミノカルボニル、又は4-フルオロフェニルであり；

R^6 は、水素、クロロ、シアノ、メトキシ、又はトリフルオロメチルであり；

R^7 は、水素である。

【0080】

別の実施形態において、本発明による式（Ⅰ）の化合物において、好ましくは：

Xは、Oであり；

R¹は、エチル又は4-トリフルオロメトキシフェニルであり；

R²は、水素、3,4-ジクロロフェニル又は4-フルオロフェニルであり；

R³は、水素であり；

R⁴は、水素、トリフルオロメチル、ブロモ、シアノ、又はアセチルであり；

R⁵は、水素、ブロモ、クロロ、フルオロ、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、アミノカルボニル、メチルスルファニル、又はメチルスルホニルであり；

R⁶は、水素、メトキシ、又はトリフルオロメチルであり；

R⁷は、水素である。

10

【0081】

別の実施形態において、本発明による式（Ⅰ）の化合物において、好ましくは：

Xは、Oであり；

R¹は、エチルであり；

R²は、3,4-ジクロロフェニル又は4-フルオロフェニルであり；

R³は、水素であり；

R⁴は、水素、トリフルオロメチル、ブロモ、又はシアノであり；

R⁵は、水素、ブロモ、クロロ、フルオロ、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、アミノカルボニル、メチルスルファニル、又はメチルスルホニルであり；

R⁶は、水素、メトキシ、又はトリフルオロメチルであり；

R⁷は、水素である。

20

【0082】

別の実施形態において、本発明による式（Ⅰ）の化合物において、好ましくは：

Xは、Oであり；

R¹は、エチルであり；

R²は、3,4-ジクロロフェニルであり；

R³は、水素であり；

R⁴は、水素、トリフルオロメチル、ブロモ、又はシアノであり；

R⁵は、水素、ブロモ、クロロ、フルオロ、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、アミノカルボニル、メチルスルファニル、又はメチルスルホニルであり；

R⁶は、水素、メトキシ、又はトリフルオロメチルであり；

R⁷は、水素である。

30

【0083】

本発明の化合物は、以下のスキームにおいて示されているとおりに形成可能であり、ここでは、別段の定めがある場合を除き、各可変要素の定義は式（Ⅰ）の化合物について上記に定義されているとおりである。式（Ⅰ）の化合物を生成するための一般的な方法は以下に記載されている。文中に別段の定めがある場合を除き、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷及びXは、本明細書中において既に定義されているとおりである。本発明の化合物の調製に用いられる出発材料は、通常の商業的な供給業者から購入し得、又は、公知の方法により調製し得る。出発材料並びに中間体は、クロマトグラフィ、結晶化、蒸留及びろ過などの最先端の技法によって、次のステップにおいて使用される前に精製してもよい。

40

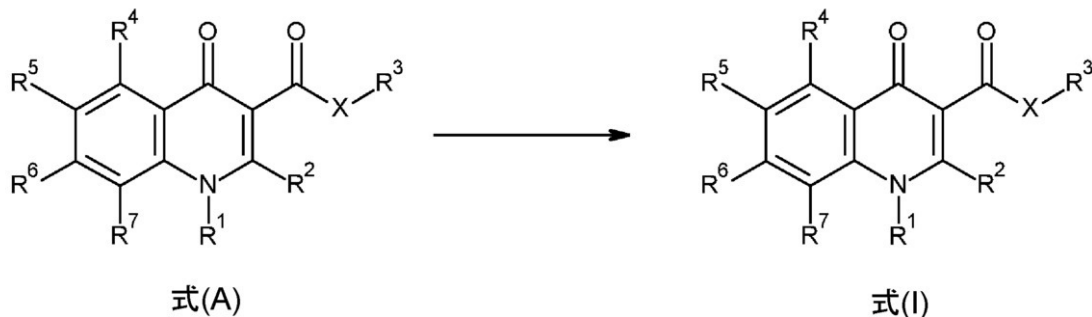
【0084】

本発明の式（Ⅰ）の化合物は、スキーム1において示すように式（A）の化合物から調製し得る。

【0085】

スキーム1：

【化 2】



10

XがOでありR³がHである式(I)の化合物は、好適な溶剤（メタノール、エタノール、ジクロロメタン、クロロホルム、酢酸エチル又はテトラヒドロフランなど）中において、任意の共溶剤（水など）を伴う、好適な塩基（水酸化ナトリウム又は水酸化リチウムなど）又は好適な酸（トリフルオロ酢酸、塩酸、ギ酸又は硫酸など）による、式(A)の化合物（式中、XはOであり、R³はHではなく、上記に定義されているいずれかの他のR³基である）の加水分解により調製され得る。塩基を用いた場合、生成物は、好適な酸（塩酸など）による酸性化の後に得られた。R⁴がピリジル又はピリダジニルである場合、生成物は同等の塩（塩酸塩など）として得られた。これを上記のスキーム1において示す。

20

【0086】

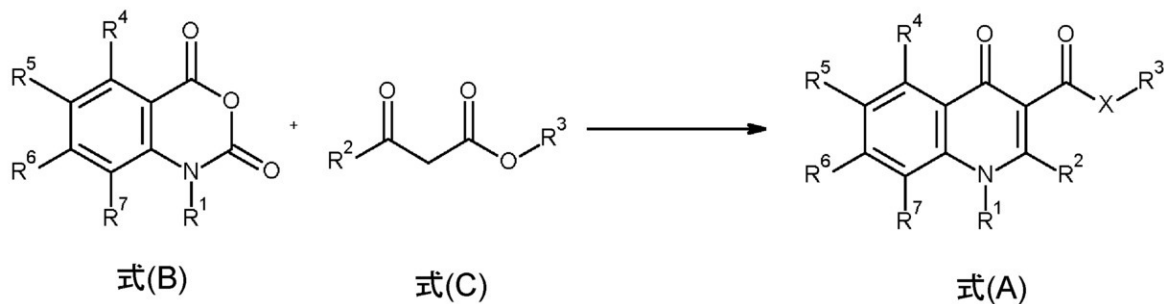
式(A)の化合物（式中、R⁴、R⁵、R⁶又はR⁷は、ハロゲンである（例えば、式中、R⁴、R⁵、R⁶又はR⁷は、Cl、Br又はIである））は、金属触媒クロスカップリング反応によって、例えば、鈴木クロスカップリングによって、式(A)の新規な化合物（式中、R⁴、R⁵、R⁶又はR⁷は、ハロゲンではない（例えば、式中、R⁴、R⁵、R⁶又はR⁷は、C₁～C₆アルキル、フェニル、又はシアノである））に変換し得る。さらなる変換において、式(A)の化合物（式中、R⁴、R⁵、R⁶又はR⁷は、ハロゲンである（例えば、式中、R⁴、R⁵、R⁶又はR⁷は、Cl、Br又はIである））は、スティルカップリング条件下でのアルケニルスタンナン試薬とのクロスカップリング、それに続く加水分解によって、式(A)の新規な化合物（式中、R⁴、R⁵、R⁶又はR⁷は、C₁～C₆アルキルカルボニルである）に変換し得る。上記及び関連するC-H a lからC-Rへの変換は当業者には公知である。

30

【0087】

スキーム2：

【化 3】



40

式(A)の化合物（式中、R³は、Hではないが、上記に定義されているような任意の他のR³基である）は、適切な塩基（例えば、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカー7-エン、カリウムビス（トリメチルシリル）アミド、炭酸カリウム又は水素化ナトリウム）を伴う、適切な溶媒（例えば、テトラヒドロフラン、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド又は水）中、所与の温度（-80℃から還流まで）での、式(B)の化合物と式(C)の化合物の反応から調製し得る。これを上記のスキーム2

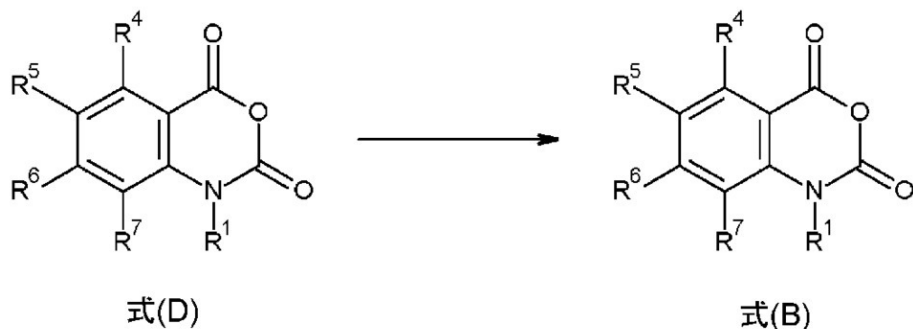
50

において示す。

【 0 0 8 8 】

スキーム 3 :

【 化 4 】



10

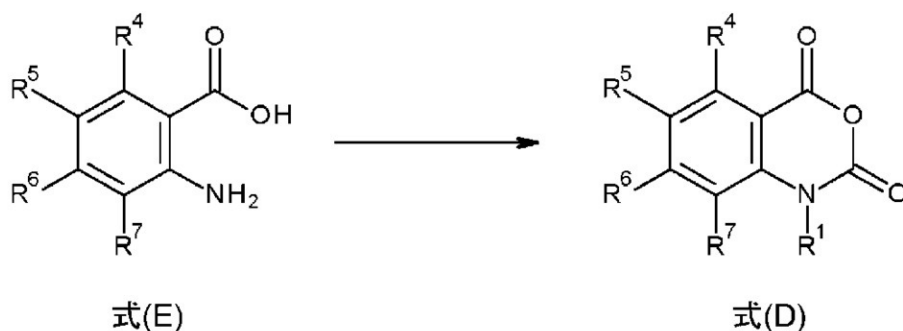
式 (B) の化合物 (式中、 R^1 は、H ではないが、上記に定義されているような任意の他の R^1 基である) は、適切な塩基 (例えば、1, 8 - ジアザビシクロ [5 . 4 . 0] ウンデカー 7 - エン、ジイソプロピルエチルアミン、炭酸ナトリウム、水酸化カリウム又は水素化ナトリウム) の存在下で、適切な溶媒 (例えば、テトラヒドロフラン、ジメチルアセトアミド又は N, N - ジメチルホルムアミド) 中、所与の温度 (例えば、室温から 5 0 °C) にて、適切なアルキル化剤 (例えば、ハロゲン化アルキル又は硫酸ジアルキル) によるアルキル化によって、式 (D) の化合物 (式中、 R^3 は、H である) から調製し得る。このような変換は、科学文献において記載されている。これを上記のスキーム 3 において示す。

20

【 0 0 8 9 】

スキーム 4 :

【 化 5 】



30

式 D の化合物は、適切な溶媒 (例えば、テトラヒドロフラン、トルエン、1, 4 - ジオキサン、アセトニトリル又はジクロロメタン) 中、任意に塩基 (例えば、ピリジン、トリエチルアミン又は水酸化ナトリウム) の存在下で、及び任意に触媒 (例えば、4 - ジメチルアミノピリジン) の存在下で、 CO^{2+} の適切な源、例えば、トリホスゲン (ビス (トリクロロメチル) カルボネート、ホスゲン、ジホスゲン、ジ - t e r t - ブチルジカルボネート又はクロロギ酸エチル) との式 E の化合物の反応によって調製し得る。これらの反応は、室温又は高温にて行い得る。これを上記のスキーム 4 において示す。

40

【 0 0 9 0 】

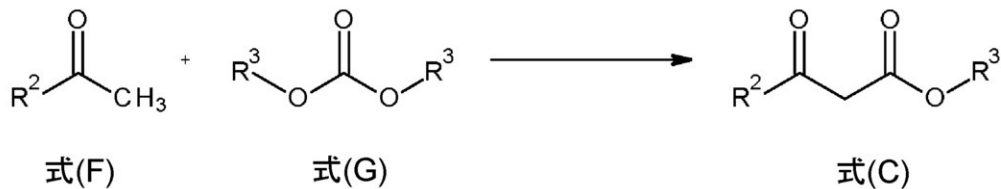
代わりに、式 (D) の化合物は、パラジウム触媒 (例えば、パラジウム (I I) アセテート) 及び銅源 (例えば、銅 (I I) アセテート) の存在下で、ヨウ化カリウムの存在下で、適切な溶媒 (例えば、アセトニトリル) 中、高温 (例えば、6 0 °C) にて、CO 源 (例えば、一酸化炭素) との反応によって式 (E) の化合物から得てもよい。式 (E) の化合物は市販であるか、又は文献において報告されている方法によって調製し得る。

【 0 0 9 1 】

50

スキーム 5 :

【化 6】



式 (C) の化合物は、式 (G) の炭酸ジアルキル (例えば、炭酸ジメチル) の存在下での塩基 (例えば、水素化ナトリウム) による式 (F) のケトンの処理によって調製し得る。式 (F) 及び式 (G) の化合物は市販であるか、又は当業者によく知られている方法によって調製し得る。これを上記のスキーム 5 において示す。

10

【0092】

本発明はさらに、生息地において雑草を防除する方法を提供するものであり、前記方法は、生息地に対する、雑草防除量の式 (I) の化合物を含む組成物の適用を含む。しかも、本発明はさらに、有用な (作物) 植物及び雑草が含まれる生息地において雑草を選択的に防除する方法を提供し得、ここで、この方法は、生息地に対する、雑草防除量の本発明に係る組成物の適用を含む。「防除」とは、駆除、成長の低減若しくは妨害、又は、発芽の防止若しくは低減を意味する。本発明の化合物は、公知の構造的に類似する化合物と比して、かなり向上した選択性を示すことに注目されたい。一般に、防除されるべき植物は、不要な植物 (雑草) である。「生息地」とは、植物が成長しているか、又は、成長することとなる領域を意味する。施用は、作物植物の発芽前及び／又は発芽後に生息地に対して行われ得る。好ましくは、本発明の化合物を作物の発芽後に生息地に施用する。いく種かの作物植物は、式 (I) の化合物による除草効果に対して先天的に耐性であり得る。

20

【0093】

式 (I) の化合物の施用量は広い限度内において様々であり得、土壌の性質、適用方法 (発芽前又は発芽後；種子粉衣；蒔き溝への適用；耕耘適用無し等)、作物植物、防除されるべき雑草、卓越的气象条件、並びに、適用方法、適用時期及び標的作物によって左右される他の要因に応じる。本発明に係る式 (I) の化合物は一般に、10～2500 g / ha、特に25～1000 g / ha、特に25～250 g / haの量で適用される。

30

【0094】

適用は一般に、典型的にはトラクタに備え付けた大面積用噴霧器によって組成物を吹き付けることにより行われるが、散粉 (粉末の場合)、滴下又は灌注などの他の方法もまた使用可能である。

【0095】

「有用な植物」という用語はまた、従来の交配又は遺伝子操作法によって、プロモキシニルのような除草剤、又は、例えば、4-ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ (HPPD) 阻害剤、ALS 阻害剤、例えばプリミスルフロン、プロスルフロン及びトリフロキシスルフロン、5-エノール-ピロビル-シキメート-3-リン酸塩-シンターゼ (EPSPS) 阻害剤、グルタミンシンターゼ (GS) 阻害剤若しくはプロトポルフィリノーゲン-オキシダーゼ (PPO) 阻害剤などのある分類の除草剤に対する耐性がもたらされた有用な植物を含むと理解されるべきである。従来の交配方法 (突然変異誘発) によって、例えばイマザモックスといったイミダゾリノンに対する耐性がもたらされた作物の一例は、Clearfield (登録商標) 夏ナタネ (カノーラ) である。遺伝子操作法によって除草剤又はあるクラスの除草剤に対する耐性がもたらされた作物の例としては、商品名Roundup Ready (登録商標)、Herculex I (登録商標) 及びLiberty Link (登録商標) で市販されているグリホサート-及びグルホシネート-耐性トウモロコシ品種が挙げられる。

40

【0096】

「有用な植物」という用語は、例えば、特にバチルス属 (Bacillus) のものと

50

いったトキシンー産生バクテリア由来の公知のものなどの1種以上の選択的に作用するトキシンを合成可能であるよう、組み換えDNA技術を用いて形質転換された有用な植物をも含むと理解されるべきである。

【0097】

このような植物の例は、Yield Gard (登録商標) (CryIA(b)トキシンを発現するトウモロコシ品種) ; Yield Gard 根食い線虫 (登録商標) (CryIIIB(b1)トキシンを発現するトウモロコシ品種) ; Yield Gard Plus (登録商標) (CryIA(b)及びCryIIIB(b1)トキシンを発現するトウモロコシ品種) ; Starlink (登録商標) (Cry9(c)トキシンを発現するトウモロコシ品種) ; Herculex I (登録商標) (CryIF(a2)トキシン及び酵素ホスフィノトリシンN-アセチルトランスフェラーゼ (PAT) を発現して、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成しているトウモロコシ品種) ; NuCOTN 33B (登録商標) (CryIA(c)トキシンを発現する綿品種) ; Bollgard I (登録商標) (CryIA(c)トキシンを発現する綿品種) ; Bollgard II (登録商標) (CryIA(c)及びCryIIA(b)トキシンを発現する綿品種) ; VIPCOT (登録商標) (VIPトキシンを発現する綿品種) ; NewLeaf (登録商標) (CryIIIAトキシンを発現するジャガイモ品種) ; NatureGard (登録商標) Agrisure (登録商標) GT利点 (GA21グリホサート耐性形質)、Agrisure (登録商標) CB利点 (Bt11コーン穿孔性害虫 (CB) 形質)、Agrisure (登録商標) RW (コーン根食い線虫形質) 及びProtecta (登録商標) である。

10

20

【0098】

植物作物又はその種子材料は共に、除草剤に耐性であると共に、同時に、昆虫による摂食 (「スタック型」トランスジェニックイベント) に耐性であることが可能である。例えば、種子は、殺虫性Cry3タンパク質発現能を有する一方で、同時に、グリホサートに耐性であることが可能である。

【0099】

作物植物はまた、交配又は遺伝子操作に係る従来の方法により得ることが可能であると共に、いわゆる出力形質 (例えば向上した保管安定性、より高い栄養価、及び、向上した風味) を含むものを含むと理解されるべきである。

30

【0100】

式(I)の化合物 (又はこれを含む組成物) は、不要な植物 (総括して「雑草」) の防除に用いることが可能である。防除される雑草は、例えばアグロステス属 (Agrostis)、スズメノテッポウ属 (Alopecurus)、カラスムギ属 (Avena)、ブラキアリア属 (Brachiaria)、スズメノチャヒキ属 (Bromus)、ケンクルス属 (Cenchrus)、カヤツリグサ属 (Cyperus)、メヒシバ属 (Digitaria)、エキノクロア属 (Echinochloa)、オヒシバ属 (Eleusine)、ドクムギ属 (Lolium)、モノコリア属 (Monochoria)、ロットボエリア属 (Rottboellia)、オモダカ属 (Sagittaria)、ホタルイ属 (Scirpus)、セタリア属 (Setaria) 及びモロコシ属 (Sorghum) といった単子葉種、並びに、例えばイチビ属 (Abutilon)、アマランサス属 (Amaranthus)、ブタクサ属 (Ambrosia)、アカザ属 (Chenopodium)、キク属 (Chrysanthemum)、イズハハコ属 (Conyza)、ヤエムグラ属 (Galium)、サツマイモ属 (Ipomoea)、オランダガラシ属 (Nasturtium)、シダ属 (Sida)、シロガラシ属 (Sinapis)、ナス属 (Solanum)、ハコベ属 (Stellaria)、クワガタソウ属 (Veronica)、ビオラ属 (Viola) 及びオナモミ属 (Xanthium) といった双子葉種の両方であり得る。

40

【0101】

式(I)の化合物は、未変性の形態で使用され得るか、又は、好ましくは、除草組成物

50

を提供するために配合物の当該技術分野において従来採用されている補助剤と一緒に、キャリア、溶剤及び表面活性薬剤（SAA）などの配合補助剤を用いて、使用され得る。本発明は従って、少なくとも1種の式（I）の化合物と、農学的に許容可能なキャリアと、任意に補助剤を含む除草組成物をさらに提供する。農業的に許容可能なキャリアは、例えば農業用の使用に好適なキャリアである。農業用キャリアは、当該技術分野において周知である。

【0102】

除草組成物は一般に、0.1～99重量%、特に0.1～95重量%の式Iの化合物と、好ましくは0～25重量%の表面活性物質を含む1～99.9重量%の配合補助剤とを含む。

10

【0103】

組成物は、多数の配合物タイプから選択可能である。これらとしては、エマルジョン濃縮物（EC）、懸濁液濃縮物（SC）、サスポエマルジョン（SE）、カプセル懸濁液（CS）、水分散性顆粒（WG）、乳化性顆粒（EG）、油中水型エマルジョン（EO）、水中油型エマルジョン（EW）、マイクロエマルジョン（ME）、油分散体（OD）、混油性フロアブル剤（OF）、混油性液体（OL）、可溶性濃縮物（SL）、超低体積懸濁液（SU）、超低体積液体（UL）、工業用濃縮物（TK）、分散性濃縮物（DC）、可溶性粉末（SP）、水和剤（WP）及び可溶性顆粒（SG）が挙げられる。いずれかの事例において選択される配合物タイプは、想定される特定の目的、並びに、式（I）の化合物の物理的、化学的及び生物学的特性に応じることとなる。

20

【0104】

可溶性粉末（SP）は、式（I）の化合物を、1種以上の水溶性無機塩（重炭酸ナトリウム、炭酸ナトリウム又は硫酸マグネシウムなど）若しくは1種以上の水溶性有機固形分（多糖類など）、及び、任意により、1種以上の湿潤剤、1種以上の分散剤、又は、前記薬剤の混合物と混合して、水への分散性／溶解度を向上させることにより調製され得る。次いで、混合物は微粉末に粉碎される。同様の組成物を粒状化して、水溶性顆粒（SG）を形成することもできる。

【0105】

水和剤（WP）は、式（I）の化合物を、1種以上の固体希釈剤又はキャリア、1種以上の湿潤剤、並びに、好ましくは、1種以上の分散剤、及び、任意により、1種以上の懸濁剤と混合して、液体における分散性を促進させることにより調製され得る。次いで、混合物は微粉末に粉碎される。同様の組成物が粒状化されて、水分散性顆粒（WG）が形成されてもよい。

30

【0106】

顆粒（GR）は、式（I）の化合物と、1種以上の粉末固体希釈剤若しくはキャリアとの混合物を造粒することにより形成され得、又は、式（I）の化合物（又は、好適な薬剤中のその溶液）を多孔性の顆粒状材料（軽石、アタパルジャイトクレイ、フォーラー土、キースラガー、珪藻土又は粉碎されたトウモロコシ穂軸など）中に吸収させ、若しくは、式（I）の化合物（又は、好適な薬剤中のその溶液）を硬質の核材料（砂、ケイ酸、炭酸塩鉱物、硫酸塩又はリン酸塩など）に吸収させ、必要に応じて乾燥させることにより予め形成されている圧縮粉顆粒から形成され得る。吸収又は吸着を助けるために通常用いられる薬剤としては、溶剤（脂肪族及び芳香族石油溶剤、アルコール、エーテル、ケトン、並びに、エステルなど）及び固着材（ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、デキストリン、糖質及び植物油など）が挙げられる。1種以上の他の添加剤もまた顆粒中に含まれていてもよい（例えば、乳化剤、湿潤剤又は分散剤）。

40

【0107】

分散性濃縮物（DC）は、式（I）の化合物を水、又は、ケトン、アルコール或いはグリコールエーテルなどの有機溶剤中に溶解させることにより調製され得る。これらの溶液は、表面活性剤を含有していてもよい（例えば、水による希釈を向上させるか、又は、噴霧タンク中での結晶化を防止するため）。

50

【0108】

乳化性濃縮物（EC）又は水中油型エマルジョン（EW）は、式（I）の化合物を有機溶剤（任意により、1種以上の湿潤剤、1種以上の乳化剤又は前記薬剤の混合物を有する）中に溶解させることにより調製され得る。ECにおいて好適に用いられる有機溶剤としては、芳香族炭化水素（SOLVESSO 100、SOLVESSO 150及びSOLVESSO 200（SOLVESSOは登録商標である）により例示されるアルキルベンゼン又はアルキルナフタレンなど）、ケトン（シクロヘキサノン又はメチルシクロヘキサノンなど）、及び、アルコール（ベンジルアルコール、フルフリルアルコール又はブタノールなど）、N-アルキルピロリドン（N-メチルピロリドン又はN-オクチルピロリドンなど）、脂肪酸ジメチルアミド（C₈～C₁₀脂肪酸ジメチルアミドなど）、及び、塩素化炭化水素が挙げられる。EC生成物は、水に添加されると自然に乳化して、適切な器具での噴霧用途が可能なほどに十分な安定性を有するエマルジョンをもたらし得る。

10

【0109】

EWの調製では、液体（室温で液体ではない場合には、典型的には70℃未満といった適切な温度で溶融されていてもよい）として、又は、溶液（適切な溶剤中に溶解させることにより）で式（I）の化合物を得、次いで、得られた液体又は溶液が1種以上のSAAを含有する水中に、高せん断下で乳化してエマルジョンがもたらされる。EWにおいて好適に用いられる溶剤としては、植物油、塩素化炭化水素（クロロベンゼンなど）、芳香族溶剤（アルキルベンゼン又はアルキルナフタレンなど）、及び、水への溶解度が低い他の適切な有機溶剤が挙げられる。

20

【0110】

ミクロエマルジョン（ME）は、1種以上の溶剤と1種以上のSAAとのブレンドを水と混合して、熱力学的に安定な等方性液体配合物を自然にもたらしことにより調製され得る。式（I）の化合物は、最初は、水又は溶剤／SAAブレンドのいずれかの中に存在している。MEにおいて好適に用いられる溶剤としては、EC又はEWにおける使用について前述されているものが挙げられる。MEは、水中油型又は油中水型系のいずれかであり得（どちらの系が存在しているかは、伝導率の測定によって判定され得る）、同一の配合物中の水溶性及び油溶性有害生物防除剤の混合に好適であればよい。MEは、マイクロエマルジョンのままで、又は、従来の水中油型エマルジョンを形成して水中に好適に希釈される。

30

【0111】

懸濁液濃縮物（SC）は、式（I）の化合物の微細な不溶性固体粒子の水性又は不水性懸濁液を含んでいてもよい。SCは、式（I）の固体化合物を、好適な媒体中で、任意により1種以上の分散剤と共にボールミル又はビーズミルにかけて、化合物の微細な粒子懸濁液をもたらすことにより調製され得る。1種以上の湿潤剤が組成物中に含まれていてもよく、懸濁剤が、粒子の沈降速度を低減するために含まれていてもよい。或いは、式（I）の化合物は、乾式ミルにかけられ、及び、明細書中に上述されている薬剤を含有する水に添加されることにより、所望の最終生成物がもたらされてもよい。

【0112】

エアロゾル配合物は、式（I）の化合物及び好適な噴射剤（例えばn-ブタン）を含む。式（I）の化合物はまた、好適な媒体（例えば水、又は、n-プロパノールなどの水和性の液体）中に溶解又は分散されて、非加圧式の手動噴霧ポンプにおける使用のための組成物がもたらされてもよい。

40

【0113】

カプセル懸濁液（CS）は、EW配合物の調製と同様に調製され得るが、油滴の各々が高分子シェルに内包されており、式（I）の化合物と、任意により、これのためのキャリア又は希釈剤とが含有されている、油滴の水性分散体を得られるような追加の重合ステージが伴う。高分子シェルは、界面重縮合反応若しくはコアセルベーション手法の一方により生成され得る。組成物は式（I）の化合物の徐放をもたらし得、種子処理に用いられ得る。式（I）の化合物はまた、生分解性高分子マトリックス中に配合されて、化合物がゆ

50

っくりとした徐放性とされてもよい。

【0114】

組成物は、例えば、式（I）の化合物の濡れ性、保持性若しくは表面上での分布性；被処理表面上での雨に対する耐性；又は、摂取若しくは易動性を向上させることにより、組成物の生物学的性能を向上するために、1種以上の添加剤を含んでいてもよい。このような添加剤としては、表面活性剤（SAA）、例えば一定の鉱油又は天然の植物油（大豆油及びナタネ油など）といった油系の噴霧添加剤、メチル化ナタネ油（MRSO）などの変性植物油、及び、これらと他の生体活性増強（bio-enhancing）補助剤（式（I）の化合物の作用を補助若しくは改変し得る処方成分）とのブレンドが挙げられる。

【0115】

湿潤剤、分散剤及び乳化剤は、カチオン性、アニオン性、両性又はノニオン性のSAAであり得る。

【0116】

好適なカチオン性のSAAとしては、第四級アンモニウム化合物（例えばセチルトリメチルアンモニウムブロミド）、イミダゾリン及びアミン塩が挙げられる。

【0117】

好適なアニオン性SAAとしては、脂肪酸のアルカリ金属塩、脂肪族モノエステルの硫酸塩（例えばラウリル硫酸ナトリウム）、スルホン化芳香族化合物の塩（例えばドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム、ブチルナフタレンスルホネート、及び、ジーイソプロピルーナフタレンスルホン酸ナトリウムとトリイソプロピルーナフタレンスルホン酸ナトリウムとの混合物）、エーテル硫酸塩、アルコールエーテル硫酸塩（例えばラウレスー3硫酸ナトリウム）、エーテルカルボキシレート（例えばラウレスー3炭酸ナトリウム）、リン酸エステル（例えば、ラウリルアルコールと四リン酸との反応といった1種以上の脂肪族アルコールとリン酸（主にモノエステル）又は五酸化リン（主にジーエステル）との反応からの生成物；また、これらの生成物はエトキシ化されていてもよい）、スルホスクシナメート、パラフィン又はオレフィンスルホン酸塩、タウレート、リグノスルホネート、及び、トリスチリルフェノールのリン酸塩／硫酸塩が挙げられる。

【0118】

好適な両性SAAとしては、ベタイン、プロピオネート、及び、グリシネートが挙げられる。

【0119】

好適なノニオン性のSAAとしては、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、又は、これらの混合物などのアルキレンオキシドと、脂肪族アルコール（オレイルアルコール又はセチルアルコールなど）若しくはアルキルフェノール（オクチルフェノール、ノニルフェノール又はオクチルクレゾールなど）との縮合物；長鎖脂肪酸又はヘキシトール無水物由来の部分エステル；前記部分エステルとエチレンオキシドとの縮合物；ブロックポリマー（エチレンオキシド及びプロピレンオキシドを含む）；アルカノールアミド；単純エステル（例えば脂肪酸ポリエチレングリコールエステル）；アミンオキシド（例えばラウリルジメチルアミンオキシド）；レシチン並びにそのソルビタン及びエステル、アルキルポリグリコシド及びトリスチリルフェノールが挙げられる。好適な懸濁剤としては、親水性コロイド（多糖類、ポリビニルピロリドン又はナトリウムカルボキシメチルセルロースなど）及び膨潤粘土（ベントナイト又はアタパルジャイトなど）が挙げられる。

【0120】

本発明の化合物はまた、1種以上の追加の除草剤及び／又は植物成長調節剤との混合物において用いることが可能である。このような追加の除草剤又は植物成長調節剤の例としては、アセトクロール、アシフルオルフェン（アシフルオルフェンナトリウムを含む）、アクロニフェン、アメトリン、アミノカルバゾン、アミノピラリド、アミノトリアゾール、アトラジン、ベフルブタミド-M、ベンキトリオン、ベンスルフロン（ベンスルフロ

10

20

30

40

50

ン-メチルを含む)、ペンタゾン、ビシクロピロン、ピラナホス、ビピラゾン、ビスピリ
 バック-ナトリウム、ビクスロゾン、ブロマシル、プロモキシニル、ブタクロール、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-エチルを含む)、クロランスラ
 ム(クロランスラム-メチルを含む)、クロリムロン(クロリムロン-エチルを含む)、
 クロロトルロン、クロルスルフロソ、シンメチリン、クラシホス、クレトジウム、クロジナ
 ホップ(クロジナホップ-プロパルギルを含む)、クロマゾン、クロピラリド、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、シハロホップ(シハロホップ-ブ
 チルを含む)、2, 4-D(そのコリン塩及び2-エチルヘキシルエステルを含む)、2
 , 4-DB、デスメディファミン、ジカンバ(そのアルミニウム、アミノプロピル、ビス-
 アミノプロピルメチル、コリン、ジクロロプロップ、ジグリコールアミン、ジメチルアミン
 、ジメチルアンモニウム、カリウム及びナトリウム塩を含む)ジクロスラム、ジフルヘニ
 カン、ジフルフェンゾピル、ジメタクロール、ジメテナミド-P、ジオキソピリトリオン
 、ダイコートジプロミド、ジウロン、エピリフェナシル、エタルフルラリン、エトフメセ
 ート、フェノキサプロップ(フェノキサプロップ-P-エチルを含む)、フェノキサスル
 フオン、フェンピラゾン、フェンキノトリオン、フェントラザミド、フラザスルフロソ、
 フロラスラム、フロルピラウキシフェン(フロルピラウキシフェン-ベンジルを含む)、
 フルアジホップ(フルアジホップ-P-ブチルを含む)、フルカルバゾン(フルカルバゾ
 ン-ナトリウムを含む)、フルフェナセット、フルメツラム、フルミオキサジン、フルオ
 メツロン、フォメサフェンフルピルスルフロソ(フルピルスルフロソ-メチル-ナトリウ
 ムを含む)、フルロキシピル(フルロキシピル-メプチルを含む)、フォメサフェン、ホ
 ラムスルフロソ、グルホシネート(L-グルホシネート及び両方のアンモニウム塩を含む)
 、グリホサート(そのジアンモニウム、イソプロピルアンモニウム及びカリウム塩を含む)
 、ハラウキシフェン(ハラウキシフェン-メチルを含む)、ハロキシホップ(ハロキシ
 ホップ-メチルを含む)、ヘキサジノン、ヒダントシジン、イマザモックス(R-イマ
 ザモックスを含む)、イマザピック、イマザピル、イマゼタピル、インダジフラム、イオ
 ドスルフロソ(イオドスルフロソ-メチル-ナトリウムを含む)、イオフエンズルフロソ
 (イオフエンズルフロソ-ナトリウムを含む)、アイオキシニル、イソプロツロン、イソ
 キサフルトール、ランコトリオン、MCPA、MCPB、メコプロップ-P、メソスルフロ
 ソ(メソスルフロソ-メチルを含む)、メソトリオン、メタミトロン、メタザクロール
 、メチオゾリン、メトラクロール、メトスラム、メトリブジン、メトスルフロソ、ナプロ
 パミド、ニコスルフロソ、ノルフラゾン、オキサジアゾン、オキサスルフロソ、オキシフ
 ルオルフェン、パラコートジクロリド、ペンディメタリン、ペノキススラム、フェンメデ
 ィファミン、ピクロラム、ピノキサデン、プレチラクロール、プリミズルフロソ-メチル、
 プロメトリン、プロパニル、プロパキサホップ、プロピリスルフロソ、プロピザミド、プ
 ロスルホカルブ、プロスルフロソ、ピラクロニル、ピラフルフェン(ピラフルフェン-エ
 チルを含む)、ピラスルホトール、ピリデート、ピリフタリド、ピリミズルファン、ピロ
 キサスルホン、ピロキシスラム、キンクロラック、キンメラック、キサロホップ(キサロ
 ホップ-P-エチル及びキサロホップ-P-テフリルを含む)、リミソキサフェン、リム
 スルフロソ、サフルフェナシル、セトキシジウム、シマジン、S-メトラクロール(S-m
 e t a l o c h l o r)、スルフェントラゾン、スルホスルフロソ、テブチウロン、テフ
 リルトリオン、テンボトリオン、テルブチラジン、テルブトリン、テトフルピロリメト、
 チエンカルバゾン、チフェンズルフロソ、チアフェナシル、トルピラレート、トブラメゾ
 ン、トラルコキシジウム、トリアファモネ、トリアレート、トリアスルフロソ、トリベヌロ
 ン(トリベヌロン-メチルを含む)、トリクロピル、トリフロキシスルフロソ(トリフロ
 キシスルフロソ-ナトリウムを含む)、トリフルジモキサジン、トリフルラリン、トリフ
 ルスルフロソ、トリピラスルホン、[(E)-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]
 メチレンアミノ]2, 6-ビス[(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)オキシ]
 安息香酸塩、3-(2-クロロ-4-フルオロ-5-(3-メチル-2, 6-ジオキソ-
 4-トリフルオロメチル-3, 6-ジヒドロピリミジン-1(2H)-イル)フェニル)
 -5-メチル-4, 5-ジヒドロイソキサゾール-5-カルボン酸エチルエステル、4-

10

20

30

40

50

ヒドロキシ-1-メトキシ-5-メチル-3-[4-(トリフルオロメチル)-2-ピリ
 ジル]イミダゾリジン-2-オン、4-ヒドロキシ-1, 5-ジメチル-3-[4-(ト
 リフルオロメチル)-2-ピリジル]イミダゾリジン-2-オン、5-エトキシ-4-ヒ
 ドロキシ-1-メチル-3-[4-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]イミダゾリ
 ジン-2-オン、4-ヒドロキシ-1-メチル-3-[4-(トリフルオロメチル)-2
 -ピリジル]イミダゾリジン-2-オン、4-ヒドロキシ-1, 5-ジメチル-3-[1
 -メチル-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-イル]イミダゾリジン-2-オ
 ン、(4R)1-(5-tert-ブチルイソキサゾール-3-イル)-4-エトキシ-
 5-ヒドロキシ-3-メチル-イミダゾリジン-2-オン、4-アミノ-3-クロロ-5
 -フルオロ-6-(7-フルオロ-1H-インドール-6-イル)ピリジン-2-カルボ
 ン酸(その農芸化学的に許容可能なエステル、例えば、メチル4-アミノ-3-クロロ-
 5-フルオロ-6-(7-フルオロ-1H-インドール-6-イルを含む)ピリジン-2
 -カルボキシレート、プロプ-2-イニル4-アミノ-3-クロロ-5-フルオロ-6-
 (7-フルオロ-1H-インドール-6-イル)ピリジン-2-カルボキシレート及びシ
 アノメチル4-アミノ-3-クロロ-5-フルオロ-6-(7-フルオロ-1H-インド
 ール-6-イル)ピリジン-2-カルボキシレート)、3-エチルスルファニル-N-(
 1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2,
 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボキサミド、3-(イソプロピルスル
 ファニルメチル)-N-(5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-5
 -(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カル
 ボキサミド、3-(イソプロピルスルホニルメチル)-N-(5-メチル-1, 3, 4
 -オキサジアゾール-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリア
 ザロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボキサミド、3-(エチルスルホニルメチル)-
 N-(5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-5-(トリフルオロメ
 チル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-8-カルボキサミド、エチ
 ル-2-[3-[3-クロロ-5-フルオロ-6-[3-メチル-2, 6-ジオキソ
 -4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-1-イル]-2-ピリジル]オキシ]アセテ
 ート、6-クロロ-4-(2, 7-ジメチル-1-ナフチル)-5-ヒドロキシ-2-メ
 チル-ピリダジン-3-オン、テトラヒドロフラン-2-イルメチル(2R)-2-[
 (4-アミノ-3, 5-ジクロロ-6-フルオロ-2-ピリジル)オキシ]プロパノエート
 、(2R)-2-[4-アミノ-3, 5-ジクロロ-6-フルオロ-2-ピリジル)オ
 キシ]プロパン酸、テトラヒドロフラン-2-イルメチル2-[4-アミノ-3, 5-
 ジクロロ-6-フルオロ-2-ピリジル)オキシ]プロパノエート、2-[4-アミノ
 -3, 5-ジクロロ-6-フルオロ-2-ピリジル)オキシ]プロパン酸、2-フルオロ
 -N-(5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-3-[4-(R)-プロ
 ピルスルフィニル]-4-(トリフルオロメチル)ベンズアミド、2-フルオロ-N-(
 5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-3-プロピルスルフィニル-
 4-(トリフルオロメチル)ベンズアミド、(2-フルオロフェニル)メチル6-アミノ
 -5-クロロ-2-(4-クロロ-2-フルオロ-3-メトキシフェニル)ピリミジン
 -4-カルボキシレート、6-アミノ-5-クロロ-2-(4-クロロ-2-フルオロ-
 3-メトキシフェニル)ピリミジン-4-カルボン酸、3-(3-クロロフェニル)-
 6-(5-ヒドロキシ-1, 3-ジメチル-ピラゾール-4-カルボニル)-1, 5-ジ
 メチル-キナゾリン-2, 4-ジオン及び[4-[3-(3-クロロフェニル)-1, 5-
 ジメチル-2, 4-ジオキソ-キナゾリン-6-カルボニル]-2, 5-ジメチル-ピ
 ラゾール-3-イル]N, N-ジエチルカルバメート、メチル2-[4-(E)-[2-クロ
 ロ-4-フルオロ-5-[3-メチル-2, 6-ジオキソ-4-(トリフルオロメチル)
 ピリミジン-1-イル]フェニル]メチレンアミノ]オキシプロパノエート及びメチル
 (2R)-2-[4-(E)-[2-クロロ-4-フルオロ-5-[3-メチル-2, 6-ジオ
 キソ-4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-1-イル]フェニル]メチレンアミノ]
 オキシプロパノエートが挙げられる。

10

20

30

40

50

【0121】

式(I)の化合物の混合相手はまた、例えばThe Pesticide Manual, Sixteenth Edition, British Crop Protection Council, 2012において記載されているとおり、エステル又は塩の形態であってもよい。

【0122】

混合物は、上記の配合物において有利に用いられることが可能である（この場合、「有効成分」は式(I)の化合物と混合相手とのそれぞれの混合物に関連する）。

【0123】

本発明の化合物又は混合物は、1種以上の除草剤毒性緩和剤と組み合わせても使用可能である。このような毒性緩和剤の例としては、ベノキサコール、クロキントセット（クロキントセットメキシルを含む）、シプロスルファミド、ジクロルミド、フェンクロラゾール（フェンクロラゾールーエチルを含む）、フェンクロリム、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン（イソキサジフェンーエチルを含む）、メフェンピル（メフェンピルージエチルを含む）、メトカミフェン及びオキサベトリニルが挙げられる。式Iの化合物と、シプロスルファミド、イソキサジフェンーエチル、クロキントセットメキシル及び／又はメトカミフェンとの混合物が特に好ましい。

【0124】

式(I)の化合物の毒性緩和剤はまた、例えばThe Pesticide Manual, 16th Edition (BCPC), 2012に記載されているとおり、エステル又は塩の形態であり得る。クロキントセットメキシルに対する言及はまた、国際公開第02/34048号に開示されているとおり、そのリチウム、ナトリウム、カリウム、カルシウム、マグネシウム、アルミニウム、鉄、アンモニウム、第四級アンモニウム、スルホニウム又はホスホニウム塩にも適用される。

【0125】

好ましくは、式(I)の化合物対毒性緩和剤の混合比は、100:1~1:10、特に20:1~1:1である。

【0126】

式(I)の化合物は通常農薬組成物の形態で用いられ、処理されるべき作物領域又は植物に、さらなる化合物と同時に、又は、順次に適用されることが可能である。これらのさらなる化合物は、例えば肥料若しくは微量元素供与物、又は、植物の成長に影響を及ぼす他の調製物であることが可能である。これらはまた、選択的な除草剤若しくは非選択的な除草剤、並びに、殺虫剤、殺菌・殺カビ剤、殺菌剤、殺線虫剤、軟体動物駆除剤、又は、これらの調製物の数種の混合物であることが可能であり、所望の場合には配合物の当該技術分野において慣例的に利用されるさらなるキャリア、界面活性剤若しくは適用促進補助剤を伴うことが可能である。

【0127】

本明細書において用いられる場合、「生息地」という用語は、植物が成長している圃場、又は栽培されている植物の種子が播種された圃場、又は種子が土壤に蒔かれることとなる圃場を意味する。これは、土壤、種子及び実生並びに確立した植生を含む。

【0128】

「植物」という用語は、種子、実生、苗、根、塊茎、茎、柄、群葉及び果実を含む植物のすべての物理的な部分を指す。

【0129】

「植物繁殖材料」という用語は、その増殖に用いられ得る種子などの植物の生殖部及び挿し木若しくは例えばジャガイモといった塊茎などの栄養体を表すと理解される。例えば種子（厳密な意味で）、根、果実、塊茎、鱗茎、根茎及び植物の部分が挙げられ得る。発芽後若しくは土壤から出芽した後に移植されることとなる発芽した植物及び若芽も挙げられる。これらの若芽は、移植前に浸漬による完全又は部分的な処置によって保護され得る。好ましくは、「植物繁殖材料」は、種子を表すと理解される。

【0130】

慣用名を用いて本明細書において言及される殺有害生物剤は、例えば、“The Pesticide Manual”, 15th Ed., British Crop Protection Council 2009から公知である。

【0131】

式(I)の化合物は、未変性の形態で使用され得るか、又は、好ましくは、配合物の当該技術分野において従来採用されている補助剤と一緒に使用され得る。この目的のために、これらは、公知の様式において、乳化性濃縮物、コーティング用ペースト、直接噴射可能若しくは希釈可能な溶液又は懸濁液、希釈エマルジョン、水和剤、可溶性粉末、粉剤、粒質物及び例えば高分子物質中のカプセルに簡便に配合され得る。組成物のタイプと同様に、吹付け、霧吹き、散粉、散布、コーティング又は掛け流しなどの施用方法は、意図される目的及びその時点での状況に応じて選択される。組成物は、安定化剤、消泡剤、粘度調節剤、バインダ又は粘着剤並びに肥料、微量元素の供給源又は特別な効果を得るための他の配合物などのさらなる補助剤も含有し得る。

10

【0132】

例えば、農業に用いられる好適なキャリア及び補助剤は、固体又は液体であり得、配合技術において有用な物質であり、例えば天然若しくは再生ミネラル物質、溶剤、分散剤、湿潤剤、粘着剤、増粘剤、バインダ又は肥料である。このようなキャリアは、例えば、国際公開第97/33890号に記載されている。

【0133】

式(I)の化合物は、通常、組成物の形態で用いられ、処理されるべき作物領域又は植物にさらなる化合物と同時に又は順次に適用され得る。これらのさらなる化合物は、例えば、肥料若しくは微量元素供与物又は植物の成長に影響を及ぼす他の調製物であり得る。これらは、選択的な除草剤若しくは非選択的な除草剤並びに殺虫剤、殺菌・殺カビ剤、殺菌剤、殺線虫剤、軟体動物駆除剤又はこれらの調製物の数種の混合物でもあり得、所望の場合には、配合物の当該技術分野において慣例的に利用されるさらなるキャリア、界面活性剤若しくは施用促進補助剤を伴う。

20

【0134】

式(I)の化合物は、組成物における唯一の有効成分であり得、また適切な場合、殺有害生物剤、殺菌・殺カビ剤、共力剤、除草剤又は植物成長調節剤などの1種以上の追加の有効成分と混合され得る。追加の有効成分は、いくつかの場合、予期しない相乗的活性をもたらし得る。

30

【0135】

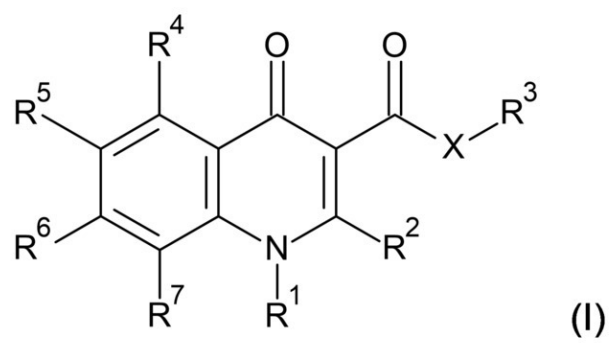
通常、配合物は、0.01~90重量%の有効薬剤、0~20%の農学的に許容可能な界面活性剤並びに10~99.99%の固体又は液体不活性配合物及び補助剤を含み、有効薬剤は、コンポーネント(B)及び(C)並びに任意に他の有効薬剤、特に殺菌剤又は防腐剤等を一緒に伴って少なくとも式(I)の化合物から構成される。組成物の濃縮形態は、一般に、約2~80%、好ましくは約5~70重量%の有効薬剤を含有する。配合物の適用形態は、例えば、0.01~20重量%、好ましくは0.01~5重量%の有効薬剤を含有し得る。市販製品は、濃縮物として配合されていることが好ましいであろうが、エンドユーザーは、通常、希釈した配合物を利用することとなる。

40

【0136】

以下の表は、本発明に係る個々の式(I)の化合物

【化 7】



10

の例を例示する。

【 0 1 3 7 】

20

30

40

50

【表 1】

表 1:本発明による式(I)の個々の化合物

化合物番号	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶
001	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	CF ₃	CF ₃	H
002	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	CF ₃	Cl	H
003	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	CF ₃	CN	H
004	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	Cl	CF ₃	H
005	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	Cl	Cl	H
006	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	Cl	CN	H
007	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	CN	Cl	H
008	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	CN	CF ₃	H
009	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	CN	CN	H
010	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	CF ₃	CF ₃
011	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	CF ₃	Cl
012	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	CF ₃	CN
013	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	Cl	CF ₃
014	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	Cl	Cl
015	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	Cl	CN
016	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	CN	CF ₃
017	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	CN	Cl
018	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	H	CN	CN
019	Et	(3-クロロ-4-シアノフェニル)	H	CF ₃	H
020	Et	(3-クロロ-4-シアノフェニル)	H	Cl	H
021	Et	(3-クロロ-4-シアノフェニル)	H	CN	H
022	Et	(3-クロロ-4-シアノフェニル)	CF ₃	CF ₃	H
023	Et	(3-クロロ-4-シアノフェニル)	H	CF ₃	CF ₃
024	Et	(4-クロロ-3-シアノフェニル)	H	CF ₃	H

10

20

30

40

50

化合物番号	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶
025	Et	(4-クロロ-3-シアノ-フェニル)	H	Cl	H
026	Et	(4-クロロ-3-シアノ-フェニル)	H	CN	H
027	Et	(4-クロロ-3-シアノ-フェニル)	CF ₃	CF ₃	H
028	Et	(4-クロロ-3-シアノ-フェニル)	H	CF ₃	CF ₃
029	Et	(4-クロロ-3-フルオロ-フェニル)	H	CF ₃	H
030	Et	(4-クロロ-3-フルオロ-フェニル)	H	Cl	H
031	Et	(4-クロロ-3-フルオロ-フェニル)	H	CN	H
032	Et	(4-クロロ-3-フルオロ-フェニル)	CF ₃	CF ₃	H
033	Et	(4-クロロ-3-フルオロ-フェニル)	H	CF ₃	CF ₃
034	Me	(3,4-ジクロロフェニル)	H	CF ₃	H

10

20

30

【0138】

表A-1は、式(I)の34の化合物A-1.001~A.1.034を提供し、式中、Xは、酸素であり、R³及びR⁷は、水素であり、R¹、R²、R⁴、R⁵、及びR⁶は、表1において定義する通りである。

【0139】

40

50

【表 2】

配合例

水和剤	a)	b)	c)
有効成分[式(I)の化合物]	25 %	50 %	75 %
リグノスルホン酸ナトリウム	5 %	5 %	—
ラウリル硫酸ナトリウム	3 %	—	5 %
ジイソブチルナフタレンスルホン酸ナトリウム	—	6 %	10 %
フェノールポリエチレングリコールエーテル (7～8 mol のエチレンオキシド)	—	2 %	—
高分散ケイ酸	5 %	10 %	10 %
カオリン	62 %	27 %	—

10

【0140】

有効成分を補助剤と十分に混合し、この混合物を好適なミルで十分に粉砕して、水で希釈して所望の濃度の懸濁液を得ることが可能である水和剤が得られる。

20

【0141】

【表 3】

乾燥種子処理に係る粉末	a)	b)	c)
有効成分[式(I)の化合物]	25 %	50 %	75 %
軽質鉱油	5 %	5 %	5 %
高分散ケイ酸	5 %	5 %	—
カオリン	65 %	40 %	—
タルカム	—	—	20 %

30

【0142】

有効成分を補助剤と十分に混合し、この混合物を好適なミルで十分に粉砕して、種子処理にそのまま使用可能である粉末が得られる。

【0143】

乳化性濃縮物

有効成分[式(I)の化合物] 10 %

40

オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル 3 %

(4～5 mol のエチレンオキシド)

ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 3 %

ヒマシ油ポリグリコールエーテル (35 mol のエチレンオキシド) 4 %

シクロヘキサノン 30 %

キシレン混合物 50 %

【0144】

植物の保護に用いることが可能であるいずれかの要求される希釈率のエマルジョンは、この濃縮物から水による希釈で得ることが可能である。

【0145】

50

【表 4】

粉剤	a)	b)	c)
有効成分[式(I)の化合物]	5 %	6 %	4 %
タルカム	95 %	—	—
カオリン	—	94 %	—
無機充填材	—	—	96 %

10

【0146】

すぐに使用可能な粉剤は、有効成分をキャリアと混合し、この混合物を好適なミルで粉碎することにより得られる。このような粉末はまた、種子の乾燥粉衣に用いることが可能である。

【0147】

押出し顆粒

有効成分 [式 (I) の化合物] 15 %

リグノスルホン酸ナトリウム 2 %

カルボキシメチルセルロース 1 %

カオリン 82 %

20

【0148】

有効成分を混合し、補助剤と共に粉碎し、この混合物を水で湿らせる。混合物を押し出し、次いで、空気流中で乾燥させる。

【0149】

被覆顆粒

有効成分 [式 (I) の化合物] 8 %

ポリエチレングリコール (mol. wt. 200) 3 %

カオリン 89 %

【0150】

細かく粉碎した有効成分を、ポリエチレングリコールで湿らせたカオリンにミキサ中で均一に適用する。粉塵を発生させない被覆顆粒がこれにより得られる。

30

【0151】

懸濁液濃縮物

有効成分 [式 (I) の化合物] 40 %

プロピレングリコール 10 %

ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル (15 mol のエチレンオキシド) 6 %

リグノスルホン酸ナトリウム 10 %

カルボキシメチルセルロース 1 %

シリコーン油 (75 % 水中エマルジョンの形態) 1 %

40

水 32 %

【0152】

細かく粉碎した有効成分を補助剤と完全に混合して懸濁液濃縮物を得、これから、いずれかの所望の希釈率を有する懸濁液を水による希釈によって得ることが可能である。このような希釈により、生存している植物、並びに、植物繁殖材料を、吹付け、注ぎかけ、又は、浸漬により処理し、微生物による外寄生から保護することが可能である。

【0153】

種子処理用フロアブル剤濃縮物

有効成分 [式 (I) の化合物] 40 %

プロピレングリコール 5 %

50

コポリマーブタノール P O / E O 2 %
 トリスチレンフェノール + 10 ~ 20 モルの E O 2 %
 1, 2-ベンズイソチアゾリン-3-オン (20 % 水溶液の形態) 0.5 %
 モノアゾ顔料カルシウム塩 5 %
 シリコン油 (75 % 水中エマルジョンの形態) 0.2 %
 水 45.3 %

【0154】

細かく粉砕した有効成分を補助剤と完全に混合して懸濁液濃縮物を得、これから、いずれかの所望の希釈率を有する懸濁液を水による希釈によって得ることが可能である。このような希釈を使用することにより、生存している植物、並びに、植物繁殖材料を、吹付け、注ぎかけ、又は、浸漬により処理し、微生物による外寄生から保護することが可能である。

10

【0155】

緩効性カプセル懸濁液

28部の式(I)の化合物の組み合わせを、2部の芳香族溶剤及び7部のトルエンジイソシアネート／ポリメチレン－ポリフェニルイソシアネート混合物(8：1)と混合する。この混合物を、1.2部のポリビニルアルコール、0.05部の脱泡剤及び51.6部の水の混合物中に、所望の粒径が達成されるまで乳化させる。このエマルジョンに、5.3部の水中の2.8部の1, 6-ジアミノヘキサンの混合物を添加する。混合物を重合反応が完了するまで攪拌する。得られるカプセル懸濁液を、0.25部の増粘剤及び3部の分散剤を添加することにより安定化させる。このカプセル懸濁液配合物は、28%の有効成分を含有する。中程度のカプセル径は8～15ミクロンである。得られた配合物は、この目的のために好適な装置で水性懸濁液として種子に適用される。

20

【実施例】

【0156】

以下の非限定的な実施例は、以下の表2において参照される代表的な本発明の化合物の特定の合成方法を提供する。

【0157】

略語のリスト

°C = 摂氏温度、d = 二重線、dd = 二重線の二重線、DMSO = ジメチルスルホキシド、M = モル、m = 多重線、MHz = メガヘルツ、q = 四重線、s = 一重線、t = 三重線。

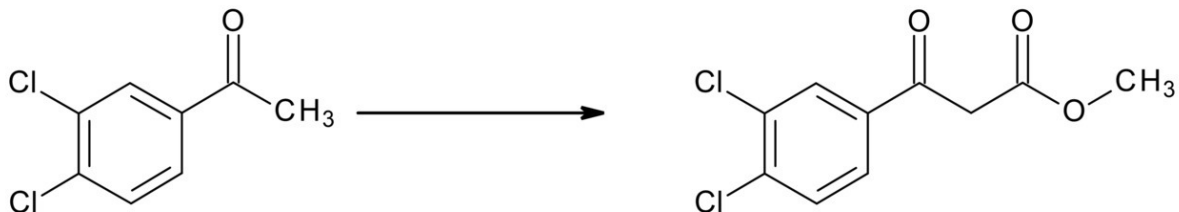
30

【0158】

実施例1：6-ブロモ-2-(3, 4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソキノリン-3-カルボン酸(化合物8)の合成

ステップ1：メチル3-(3, 4-ジクロロフェニル)-3-オキソプロパノエートの合成

【化8】



40

3, 4-ジクロロ安息香酸(10.0 g、52 mmol)のテトラヒドロフラン(40 mL)溶液に、0 °Cにて及び窒素下で、内部温度を<10 °Cに維持しながら1, 1'-カルボニルジイミダゾール(9.3 g、57 mmol)を少しずつ添加した。添加が完了すると、冷却槽を除去し、反応混合物を室温にて1時間攪拌し、黄色の溶液を得た。この溶液をカリウム；3-メトキシ-3-オキソプロパノ酸(12.2 g、77.6 mmol)及び塩化マグネシウム(7.4 g、78 mmol)のテトラヒドロフラン(30 mL)

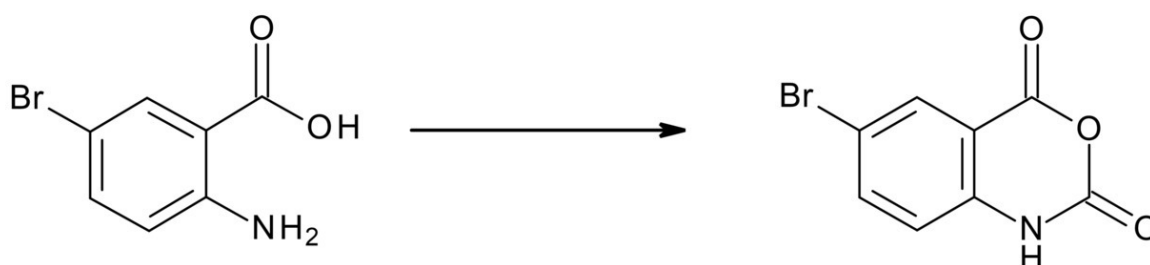
50

懸濁液に室温にて滴下で添加し、濃密な沈殿物を得た。混合物を70℃にて2時間、次いで、50℃にてさらに2時間加熱した。冷却した反応混合物を塩化水素水溶液（2M）及びジエチルエーテルに分配した。有機抽出物を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、次いで、無水硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下で蒸発乾固した。粗生成物を、溶離液としてシクロヘキサン中の0～20%酢酸エチルの勾配を使用したシリカゲル上のフラッシュクロマトグラフィーによって精製し、メチル3-（3，4-ジクロロフェニル）-3-オキソプロパノエート（互変異性体の混合物）を無色の液体（10.0g、40.5mmol）として得た。エノール：¹H NMR（400MHz，クロロホルム） δ = 12.47（s，1H），7.87（d，1H），7.59（m，3H），7.49（d，1H），5.65（s，1H），3.82（s，3H）。ケト：¹H NMR（400MHz，クロロホルム） δ = 8.03（d，1H），7.77（m，1H），7.58（d，2H），3.97（s，2H），3.76（s，3H）。

10

【0159】

ステップ1'：6-ブロモ-1H-3，1-ベンゾオキサジン-2，4-ジオンの合成
【化9】



20

2-アミノ-5-ブロモ-安息香酸（1.00g、4.6mmol）のテトラヒドロフラン（20mL）溶液を0℃に冷却し、トリホスゲン（ビス（トリクロロメチル）カーボネート（1.6g、5.2mmol）を少しずつ添加し、濁った懸濁液を得た。0.25時間後、反応混合物を室温へと温め、それによって懸濁液は溶解した。結果として生じた反応混合物を室温にて2時間攪拌し、その後、これを水中に注ぎ、ジクロロメタン中に抽出した。有機抽出物を無水硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下で蒸発乾固し、6-ブロモ-1H-3，1-ベンゾオキサジン-2，4-ジオンを薄灰色の固体（1.11g、4.59mmol）として得た。¹H NMR（400MHz，メタノール） δ = 8.15（d，1H），7.81（dd，1H），7.09（d，1H）。

30

【0160】

ステップ2：6-ブロモ-1-エチル-3，1-ベンゾオキサジン-2，4-ジオンの合成
【化10】



40

6-ブロモ-1H-3，1-ベンゾオキサジン-2，4-ジオン（2.22g、9.17mmol）のテトラヒドロフラン（50mL）溶液に、ヨードエタン（1.5mL、19mmol）、それに続いて、1，8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エ

50

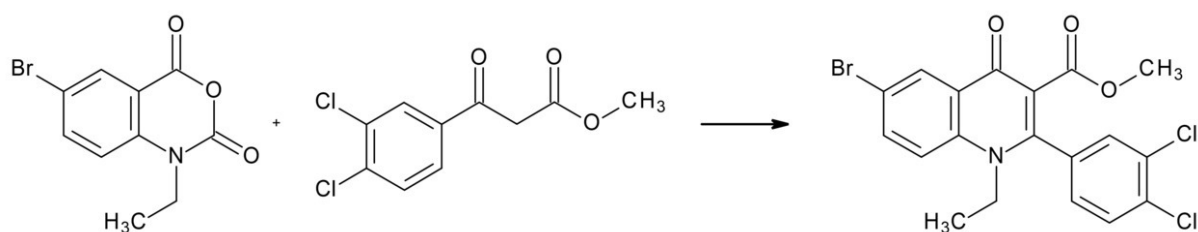
ン (DBU、1.6 mL、10 mmol) を添加した。結果として生じた溶液を室温にて 0.25 時間攪拌し、次いで、50℃にて 3 時間加熱した。結果として生じた反応混合物を塩化水素水溶液 (2 M) 中に注ぎ、ジクロロメタン中に抽出し、減圧下で蒸発乾固した。粗生成物を、水中のアセトニトリルの勾配を使用した C-18 シリカゲル上の逆相フラッシュクロマトグラフィーによって精製し、6-ブロモ-1-エチル-3,1-ベンゾオキサジン-2,4-ジオンを黄褐色の固体 (2.15 g、7.96 mmol) として得た。¹H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.28 (d, 1H), 7.85 (dd, 1H), 7.09 (d, 1H), 4.13 (q, 2H), 1.38 (t, 3H)。

【0161】

ステップ 2' : メチル 6-ブロモ-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソキノリン-3-カルボキシレート (化合物 7) の合成

10

【化 11】



6-ブロモ-1-エチル-3,1-ベンゾオキサジン-2,4-ジオン (2.15 g、7.96 mmol) 及びメチル 3-(3,4-ジクロロフェニル)-3-オキソプロパノエート (2.2 g、8.9 mmol) のテトラヒドロフラン (50 mL) 溶液に、0℃にて、1,8-ジアザビシクロ [5.4.0] ウンデカ-7-エン (DBU、2.7 mL、18 mmol) を滴下で添加した。5 分後、冷却装置を除去し、反応混合物を 50℃にて 3 時間加熱した。冷却した反応混合物を減圧下で蒸発乾固した。粗生成物を、溶離液としてシクロヘキサン中の 0~80% 酢酸エチルの勾配を使用したシリカゲル上のフラッシュクロマトグラフィーによって精製し、メチル 6-ブロモ-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソキノリン-3-カルボキシレートをクリーム色の固体 (1.77 g、3.89 mmol) として得た。¹H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.64 (d, 1H), 7.81 (dd, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.28 (dd, 1H), 4.01 (q, 2H), 3.59 (s, 3H), 1.28 (t, 3H)。

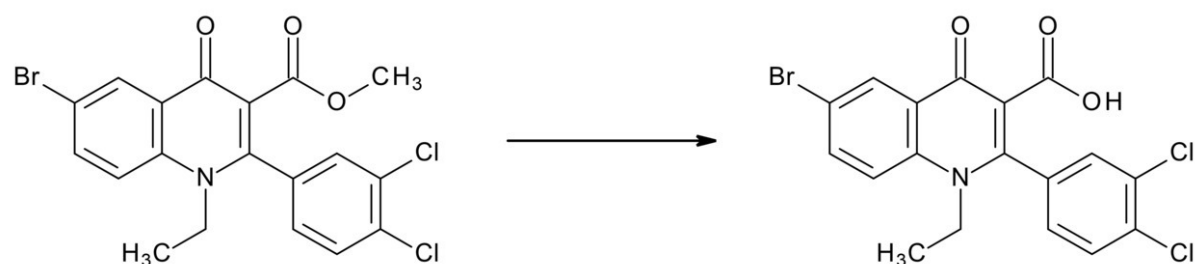
20

30

【0162】

ステップ 3 : 6-ブロモ-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソキノリン-3-カルボン酸 (化合物 8) の合成

【化 12】



40

メチル 6-ブロモ-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソキノリン-3-カルボキシレート (0.80 g、1.8 mmol) のメタノール (10 mL) 及び水 (5 mL) の混合物溶液に、水酸化リチウム (0.30 g、7.1 mmol) を添加した。結果として生じた反応混合物を 90℃にて 3 時間加熱した。冷却した反応混合物を減圧下で蒸発乾固し、粗生成物を水に懸濁させた。混合物を希釈された塩化水素水溶液 (2 M) を使用して pH 1 に酸性化し、沈殿した固体をジクロロメタン中に抽出し、減

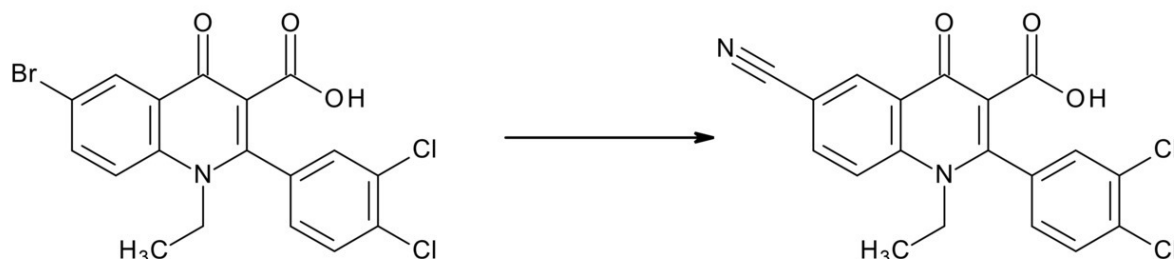
50

圧下で蒸発乾固し、6-ブロモ-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソキノリン-3-カルボン酸をクリーム色の固体(0.71g、1.6mmol)として得た。¹H NMR(400MHz, クロロホルム) δ = 15.54 (brs, 1H), 8.77 (d, 1H), 7.96 (dd, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.15 (dd, 1H), 4.14 (q, 2H), 1.33 (t, 3H)。

【0163】

実施例2: 6-シアノ-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソキノリン-3-カルボン酸(化合物7)の合成

【化13】



6-ブロモ-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソキノリン-3-カルボン酸(0.200g、0.45mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド(10mL)溶液に、シアン化亜鉛(0.105g、0.894mmol)及びテトラキス(トリフェニル- λ^5 -ホスファニル)パラジウム(0.050g、0.043mmol)を添加し、反応混合物をマイクロ波照射下で160'にて0.75時間加熱した。冷却した反応混合物を水及びジクロロメタンに分配した。有機抽出物を減圧下で蒸発乾固し、粗残渣を、溶離液としてシクロヘキサン中の0~100%酢酸エチルの勾配を使用したシリカゲル上のフラッシュクロマトグラフィーによって精製し、6-シアノ-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソキノリン-3-カルボン酸をクリーム色の固体(0.060g、0.15mmol)として得た。¹H NMR(400MHz, クロロホルム) δ = 15.12 (brd, 1H), 8.96 (d, 1H), 8.07 (dd, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.16 (dd, 1H), 4.18 (q, 2H), 1.36 (t, 3H)。

【0164】

実施例3: 5-アセチル-4-オキソ-1-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]キノリン-3-カルボン酸(化合物19)の合成

ステップ1: メチル5-(1-エトキシビニル)-4-オキソ-1-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]キノリン-3-カルボキシレートの合成

10

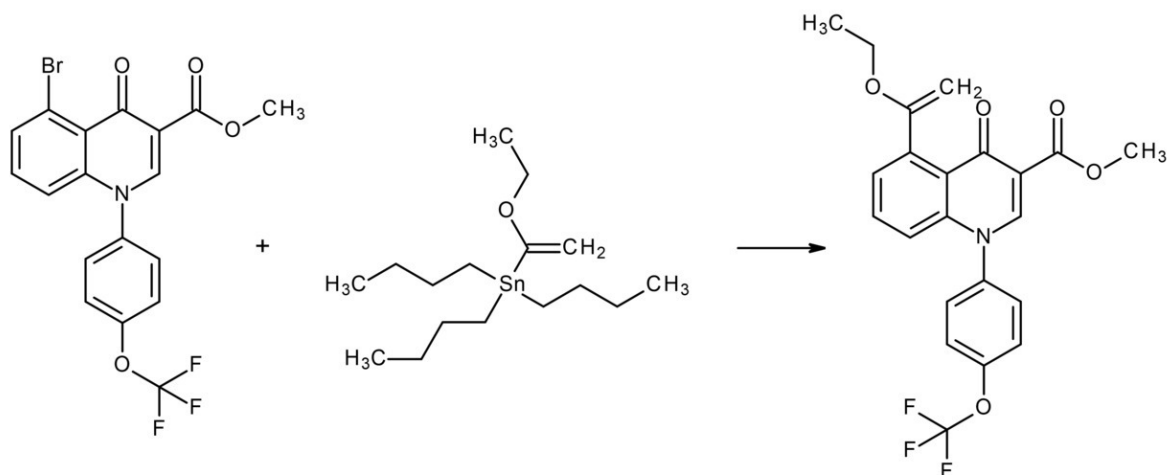
20

30

40

50

【化 1 4】



10

攪拌したメチル 5-ブromo-4-オキソ-1-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]キノリン-3-カルボキシレート (500 mg、1.07 mmol) のトルエン (15 mL) 溶液に、トリブチル (1-エトキシビニル) スタンナン (0.55 mL、1.6 mmol) を室温にて添加した。結果として生じた反応混合物をアルゴンで 5 分間パージし、それに続いて、ビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (II) クロリド (0.078 g、0.11 mmol) を添加した。結果として生じた反応混合物をアルゴンでパージし、次いで、100 °C にて 1 時間攪拌しながら加熱した。冷却した反応混合物を珪藻土を通して濾過し、濾液を減圧下で蒸発乾固した。粗残渣を、溶離液としてヘキサン中の 10% 酢酸エチルを使用したシリカゲル上のフラッシュクロマトグラフィーによって精製し、メチル 5-(1-エトキシビニル)-4-オキソ-1-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]キノリン-3-カルボキシレートを黄色の固体として得た。¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ = 8.40 (s, 1H), 7.81 (d, 2H), 7.68 (d, 2H), 7.57 (t, 1H), 7.26 (d, 1H), 6.92 (d, 1H), 4.26 (s, 1H), 4.05 (s, 1H), 3.94–3.89 (m, 2H), 3.72 (s, 3H), 1.21 (t, 3H).

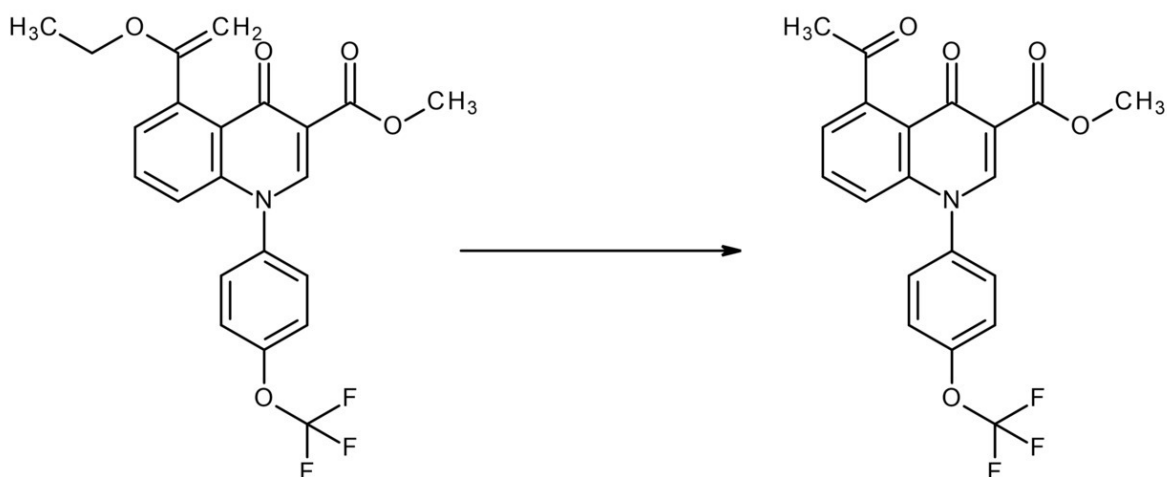
20

30

【0165】

ステップ 2：メチル 5-アセチル-4-オキソ-1-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]キノリン-3-カルボキシレートの合成

【化 1 5】



40

攪拌したメチル 5-(1-エトキシビニル)-4-オキソ-1-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]キノリン-3-カルボキシレート (890 mg、2.05 mmol)

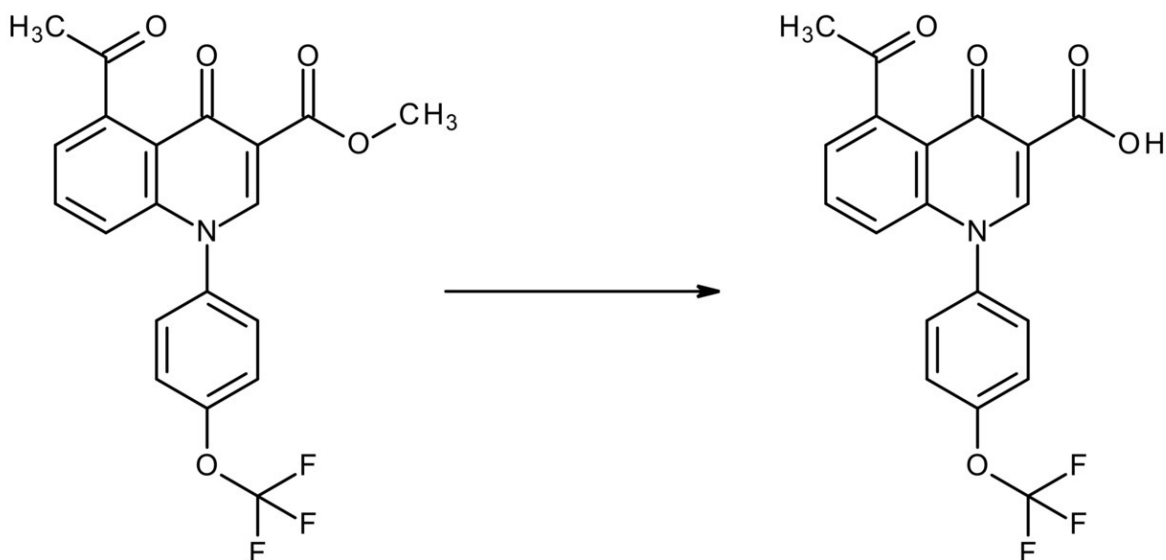
50

）のアセトン（15 mL）溶液に、室温にて希釈された塩化水素水溶液（2 M、5 mL）を添加した。結果として生じた反応混合物を室温にて16時間撹拌した。反応混合物を減圧下で蒸発させ、粗残渣を、溶離液としてヘキサン中の0～75%酢酸エチルの勾配を使用したシリカゲル上のフラッシュクロマトグラフィーによって精製し、メチル5-アセチル-4-オキソ-1-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]キノリン-3-カルボキシレートを得た。¹H NMR（400 MHz, DMSO-d₆） δ = 8.64 (s, 1H), 7.86 (d, 2H), 7.71 (t, 3H), 7.26 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 3.72 (s, 3H), 2.39 (s, 3H)

【0166】

ステップ3：5-アセチル-4-オキソ-1-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]キノリン-3-カルボン酸（化合物19）の合成

【化16】



撹拌したメチル5-アセチル-4-オキソ-1-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]キノリン-3-カルボキシレート（100 mg、0.22 mmol）のテトラヒドロフラン（5 mL）溶液に、室温にて水酸化リチウム水和物（0.019 g、0.44 mmol）の水（1 mL）溶液を添加した。結果として生じた反応混合物を室温にて1時間撹拌した。反応混合物を減圧下で蒸発乾固し、粗生成物を水（20 mL）に懸濁させた。混合物を希釈された塩化水素水溶液（2 M、5 mL）の添加によって中和し、沈殿した固体をろ過し、減圧下で乾燥させ、5-アセチル-4-オキソ-1-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]キノリン-3-カルボン酸を得た。¹H NMR（400 MHz, クロロホルム） δ = 14.01 (s, 1H), 8.78 (s, 1H), 7.74–7.70 (m, 1H), 7.56–7.51 (m, 4H), 7.33–7.31 (dd, 1H), 7.17–7.14 (dd, 1H), 2.61 (s, 3H)

【0167】

10

20

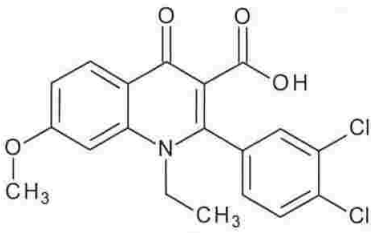
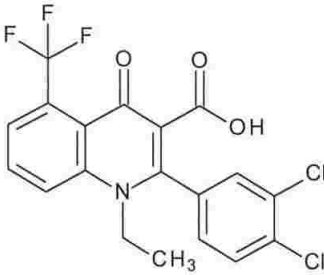
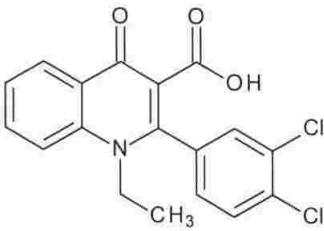
30

40

50

【表 5】

表 2:本発明による選択された化合物についての ^1H NMR データ。

化合物番号	化合物名	構造及び ^1H NMR データ
1	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-7-メトキシ-4-オキソキノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400 MHz, メタノール) δ = 8.50 (d, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.34 – 7.21 (m, 3H), 4.21 (q, 2H), 4.04 (s, 3H), 1.35 (t, 3H)
2	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-5-(トリフルオロメチル)キノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.09 – 8.03 (m, 1H), 8.01 – 7.90 (m, 2H), 7.68 – 7.59 (m, 1H), 7.42 – 7.37 (m, 1H), 7.20 – 7.07 (m, 1H), 4.27 – 4.12 (m, 2H), 1.38 – 1.26 (m, 3H)
3	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソキノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400MHz, クロロホルム) δ = 15.90 (brs, 1H), 8.64 (dd, 1H), 7.91 (ddd, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.63

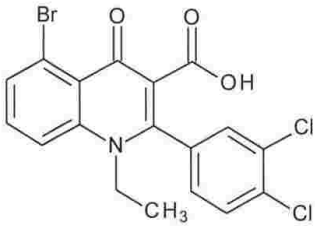
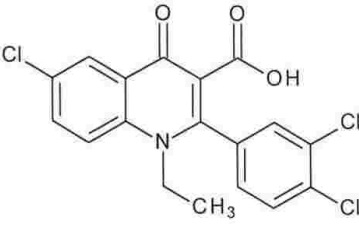
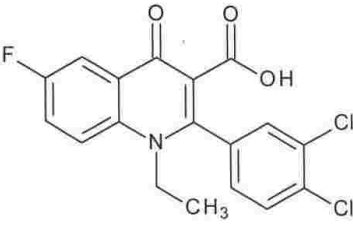
10

20

30

40

50

化合物番号	化合物名	構造及び ^1H NMR データ
		(d, 1H), 7.64 (ddd, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.16 (dd, 1H), 4.17 (d, 2H), 1.35 (t, 3H)
4	5-ブromo-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソキノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400 MHz, メタノール) δ = 7.92 (dd, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.70 – 7.64 (m, 2H), 7.45 (d, 1H), 7.20 (dd, 1H), 4.219 (q, 2H), 1.34 (t, 3H)
5	6-クロロ-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソキノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 15.55 (brs, 1H), 8.60 (d, 1H), 7.83 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.15 (dd, 1H), 4.15 (q, 2H), 1.34 (t, 3H)
6	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-フルオロ-4-オキソキノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 15.61 (brs, 1H), 8.26 (dd, 1H), 7.77 (dd, 1H), 7.68 – 7.59 (m, 2H), 7.39 (d, 1H), 7.15 (dd, 1H), 4.17 (q, 2H), 1.35 (t, 3H)

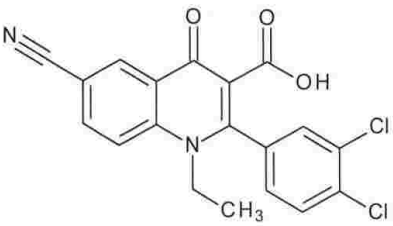
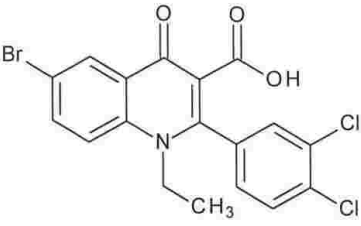
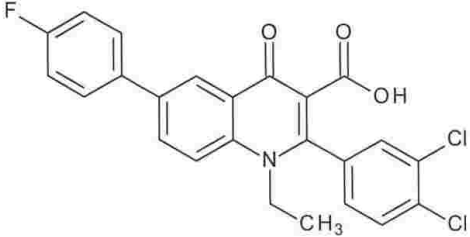
10

20

30

40

50

化合物番号	化合物名	構造及び ^1H NMR データ
7	6-シアノ-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソキノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 15.12 (brd, 1H), 8.96 (d, 1H), 8.07 (dd, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.16 (dd, 1H), 4.18 (q, 2H), 1.36 (t, 3H)
8	6-ブロモ-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソキノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 15.55 (brs, 1H), 8.77 (d, 1H), 7.97 (dd, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.15 (dd, 1H), 4.14 (q, 2H), 1.34 (t, 3H)
9	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-(4-フルオロフェニル)-4-オキソキノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ = 8.72 (d, 1H), 8.19 (brd, 1H), 8.02 (brd, 1H), 7.78 (dd, 2H), 7.69 (d, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.32 (dd, 1H), 7.25 (t, 2H), 4.25 (q, 2H), 1.36 (t, 3H)

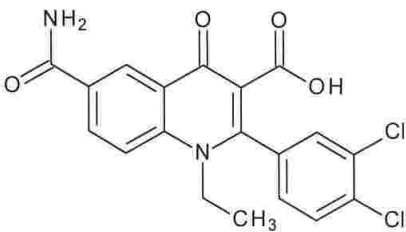
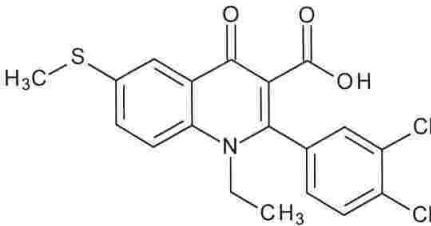
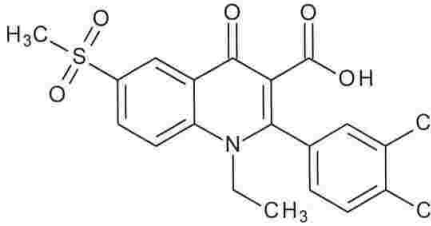
10

20

30

40

50

化合物番号	化合物名	構造及び ^1H NMR データ
10	6-(カルバモイル-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソキノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ = 15.31 (brs, 1H), 8.97 (brd, 1H), 8.45 – 8.35 (m, 2H), 8.18 (brd, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.84 (brd, 1H), 7.65 (brs, 1H), 7.52 (dd, 1H), 4.16 (brd, 2H), 1.21 (brt, 3H)
11	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-メチルスルファニル-4-オキソキノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.33 (d, 1H), 7.73 (dd, 1H), 7.65 – 7.59 (m, 2H), 7.40 (d, 1H), 7.16 (dd, 1H), 4.15 (q, 2H), 2.65 (s, 3H), 1.33 (t, 3H)
12	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-メチルスルホニル-4-オキソキノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ = 14.35 (brs, 1H), 8.85 (d, 1H), 8.41 – 8.27 (m, 2H), 7.91 – 7.83 (m, 2H), 7.54 (dd, 1H), 4.20 – 4.11 (m, 2H), 3.37 (s, 3H), 1.21 (brt, 3H)

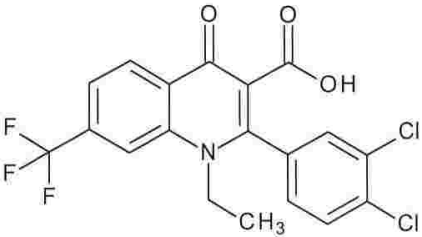
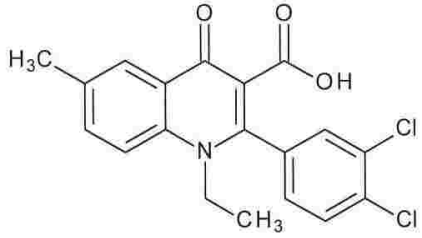
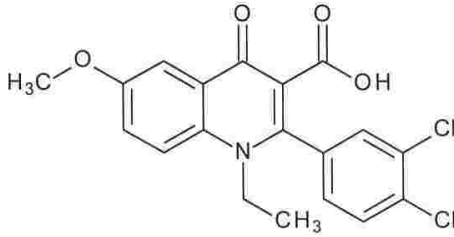
10

20

30

40

50

化合物番号	化合物名	構造及び ^1H NMR データ
13	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-7-(トリフルオロメチル)キノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 15.38 (brs, 1H), 8.79 (d, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.86 (dd, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.16 (dd, 1H), 4.21 (q, 2H), 1.38 (t, 3H)
14	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-メチル-4-オキソキノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.43 (d, 1H), 7.74 – 7.69 (m, 1H), 7.66 – 7.60 (m, 2H), 7.40 (d, 1H), 7.16 (dd, 1H), 4.15 (q, 2H), 2.57 (s, 3H), 1.33 (t, 3H)
15	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-メトキシ-4-オキソキノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.97 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.49 (dd, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.16 (dd, 1H), 4.16 (q, 2H), 4.00 (s, 3H), 1.34 (t, 3H)

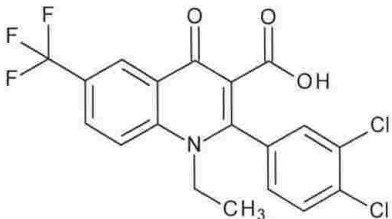
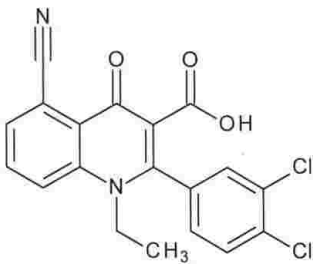
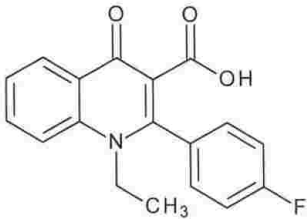
10

20

30

40

50

化合物番号	化合物名	構造及び ^1H NMR データ
16	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソ-6-(トリフルオロメチル)キノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 15.37 (brs, 1H), 8.93 (d, 1H), 8.09 (dd, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.16 (dd, 1H), 4.19 (q, 2H), 1.36 (t, 3H)
17	5-シアノ-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-4-オキソキノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ = 14.12 (brs, 1H), 8.53 – 8.33 (m, 1H), 8.21 – 8.00 (m, 2H), 7.88 (brs, 1H), 7.69 – 7.50 (m, 2H), 4.14 (brd, 2H), 1.19 (brs, 3H)
18	1-エチル-2-(4-フルオロフェニル)-4-オキソキノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400 MHz, アセトニトリル) δ = 8.58 (dt, 1H), 7.98 (d, 2H), 7.72 – 7.65 (m, 1H), 7.43 – 7.38 (m, 2H), 7.35 – 7.28 (m, 2H), 4.17 (q, 2H), 1.26 (t, 3H)

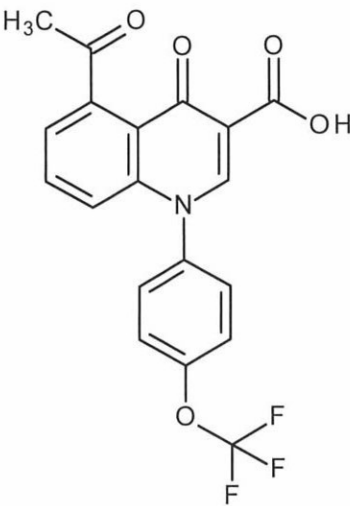
10

20

30

40

50

化合物番号	化合物名	構造及び ^1H NMR データ
19	5-アセチル-4-オキソ-1-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]キノリン-3-カルボン酸	 ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 14.01 (s, 1H), 8.78 (s, 1H), 7.74 – 7.70 (m, 1H), 7.56 – 7.51 (m, 4H), 7.33 – 7.31 (dd, 1H), 7.17 – 7.14 (dd, 1H), 2.61 (s, 3H)

10

20

30

40

50

【0168】

生物学的実施例

多様なテスト種の種子をポット中の標準土壌に播種する（イチビ（*Abutilon theophrasti*）（ABUTH）、アメリカアサガオ（*Ipomoea hederacea*）（IPOHE）、アキノエノコログサ（*Setaria faberi*）（SETFA）、ウスゲケイヌビエ（*Echinochloa crus-galli*）（ECHCG）、トウモロコシ（*Zea mays*）（ZEAMX）、アオゲイトウ（*Amaranthus retroflexus*）（AMARE）、イヌホオズキ（*Solanum nigrum*）（SOLNI）、ホソムギ（*Lolium perenne*）（LOLPE）、オオホナガアオゲイトウ（*Amaranthus palmeri*）（AMAPA））。制御された条件下に温室（24℃／16℃、昼／夜；14時間の明かり；65%湿度）で8日間栽培した後、0.5% Tween 20（ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、CAS RN 9005-64-5）を含むアセトン／水（50：50）溶液中の工業用有効成分の配合物由来の水性噴霧溶液を植物に噴霧する。別段の定めがある場合を除き、化合物は、1000g／haで適用する。次いで、制御された条件下に温室（24℃／16℃、昼／夜；14時間の明かり；65%湿度）中でテスト植物を育て、毎日2回給水した。13日後、テストを、植物による損傷の割合について評価する。生物学的活性を5段階で以下の表に示す（5＝81～100%；4＝61～80%；3＝41～60%；2＝21～40%；1＝0～20%、－＝未試験）。

【0169】

【表 6】

表B1:発芽前試験

化合物 番号	ABUTH	IPOHE	SETFA	ECHCG	ZEAMX	AMARE	SOLNI	LOLPE	AMAPA
1	3	2	2	1	1	0	－	－	－
2	2	2	5	5	1	2	2	0	－
3	1	3	5	5	3	2	4	3	－
4	－	1	5	5	3	1	－	－	2
5	－	0	2	0	1	0	－	－	0
6	－	0	5	5	0	0	－	－	0
7	－	1	5	5	3	0	－	－	0
8	－	1	5	5	2	1	－	－	2
9	－	1	4	3	1	0	－	－	0
10	－	0	0	0	2	0	－	－	0
11	－	1	5	5	2	1	－	－	3
12	－	1	5	5	1	3	－	－	3
13	－	0	0	0	0	0	－	－	0
14	－	2	4	4	2	5	－	－	5
15	－	2	5	4	1	3	－	－	3
16	－	1	5	5	1	1	－	－	0
17	－	1*	－	－	－	1*	－	－	1*
18		0	3	2	0	1	－	－	1
19	－	0	3	3	0	0	－	－	0

*化合物は250g/haで施用する

【 0 1 7 0 】

【表 7】

表B2:発芽後試験

化合物 番号	ABUTH	IPOHE	SETFA	ECHCG	ZEAMX	AMARE	SOLNI	LOLPE	AMAPA
1	－	3	2	1	0	0	－	－	－
2	3	3	4	5	3	2	2	1	－
3	2	4	4	3	1	3	4	2	－
4	－	1	1	1	1	0	－	－	0
5	－	1	4	－	2	1	－	－	1
6	－	3	4	4	4	1	－	－	3
7	－	2	4	－	3	3	－	－	4
8	－	4	4	4	4	0	－	－	1
9	－	2	0	0	0	2	－	－	2
10	－	1	4	－	2	2	－	－	4
11	－	1	3	4	2	2	－	－	3
12	－	2	3	4	1	3	－	－	2
13	－	0	1	2	1	2	－	－	1
14	－	3	3	3	2	5	－	－	5
15	－	2	2	3	1	2	－	－	2
16	－	2	4	4	3	0	－	－	0
17	－	2*	1*	1*	0*	2*	－	－	2*
18	－	0	1	1	1	1	－	－	1
19	－	1	3	4	3	0	－	－	2

*化合物は250g/haで施用する

10

20

30

40

50

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/053441

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D215/22 C07D215/56 A01N43/42
ADD.

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
C07D A01N

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

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

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	CN 108 617 661 A (OCEAN UNIV CHINA) 9 October 2018 (2018-10-09) cited in the application Compound X has been tested according to [0068]; page 5; compounds IV, X -----	1-15
X	CN 113 735 769 A (UNIV TAIYUAN TECHNOLOGY) 3 December 2021 (2021-12-03) CAS RN 195988-50-2 Same technical field; page 6, paragraph 0028 - paragraph 0029 -----	1-15
X	WO 2022/010150 A1 (ILAB [KR]) 13 January 2022 (2022-01-13) several compounds; page 38, paragraph 421 page 26; compound 2a ----- -/-	1-10

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

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

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

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

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

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

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

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

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

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

23 February 2023

Date of mailing of the international search report

03/03/2023

Name and mailing address of the ISA/
European Patent Office, P.B. 5618 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Goss, Ilaria

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/053441

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	COPPOLA G M ET AL: "THE CHEMISTRY OF 2H-3,1-BENZOXAZINE-2,4(1H)DIONE (ISATOIC ANHYDRIDE). 7. REACTIONS WITH ANIONS OF ACTIVE METHYLENES TO FORM QUINOLINES", JOURNAL OF HETEROCYCLIC CHEMISTRY, WILEY-BLACKWELL PUBLISHING, INC, US, vol. 16, 1 January 1979 (1979-01-01), pages 1605-1610, XP002270881, ISSN: 0022-152X, DOI: 10.1002/JHET.5570160817 Table III, several compounds Table IV, compound 85; page 1609 - page 1610 -----	1-10
X	CN 108 623 563 A (OCEAN UNIV CHINA) 9 October 2018 (2018-10-09) VI, XII; page 5 -----	1-10
X	JIAN-PING LIN ET AL: "Transition metal-free one-pot synthesis of 2-substituted 3-carboxy-4-quinolone and chromone derivatives", CHEMICAL COMMUNICATIONS, vol. 49, no. 46, 1 January 2013 (2013-01-01), pages 5313-5315, XP055597047, UK ISSN: 1359-7345, DOI: 10.1039/c3cc41690a Table 1 and Table 2, Compound 4a, 4b-4j and few other compounds; page 5314 -----	1-10
X	HUANG PEI-QIANG ET AL: EUROPEAN JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY , vol. 2017, no. 3 18 January 2017 (2017-01-18), pages 582-592, XP055938306, DE ISSN: 1434-193X, DOI: 10.1002/ejoc.201601326 Retrieved from the Internet: URL:https://api.wiley.com/onlinelibrary/tdm/v1/articles/10.1002%2Fejoc.201601326 Synthesis of 4-quinolone Compound 11; page 585 -----	1-10
4	A CN 108 623 562 A (OCEAN UNIV CHINA) 9 October 2018 (2018-10-09) Reference to a relevant agricultural insecticides; page 13, paragraph [0006] -----	1-15
1	----- -/--	

Form PCT/ISA/210 (continuation of second sheet) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/053441

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	US 2021/008045 A1 (SHAO CHANGLUN [CN] ET AL) 14 January 2021 (2021-01-14) Last general formula of intermediates The difference resides in present R1 being in that formula always H; page 48 -----	1-10

1

10

20

30

40

50

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2023/053441

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
CN 108617661	A	09-10-2018	NONE	
CN 113735769	A	03-12-2021	NONE	
WO 2022010150	A1	13-01-2022	KR 20220005991 A WO 2022010150 A1	14-01-2022 13-01-2022
CN 108623563	A	09-10-2018	NONE	
CN 108623562	A	09-10-2018	NONE	
US 2021008045	A1	14-01-2021	CN 108929323 A US 2021008045 A1 WO 2018171740 A1	04-12-2018 14-01-2021 27-09-2018

10

20

30

40

50

フロントページの続き

,MC,ME,MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CV,CZ,DE,DJ,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IQ,IR,IS,IT,JM,JO,JP,KE,KG,KH,KN,KP,KR,KW,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,MG,MK,MN,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,WS,ZA,ZM,ZW

(特許庁注：以下のものは登録商標)

1. T W E E N

- (72)発明者 モリス ジェームス アラン
イギリス アールジー４２ ６イーワイ バークシャー ブラックネル シンジェンタ ジーロズ ヒル
インターナショナル リサーチ センター シンジェンタ リミテッド内
- (72)発明者 アンダーソン ザーイ ジェーン
イギリス アールジー４２ ６イーワイ バークシャー ブラックネル シンジェンタ ジーロズ ヒル
インターナショナル リサーチ センター シンジェンタ リミテッド内
- (72)発明者 セデン ピーター ティモシー
イギリス アールジー４２ ６イーワイ バークシャー ブラックネル シンジェンタ ジーロズ ヒル
インターナショナル リサーチ センター シンジェンタ リミテッド内
- (72)発明者 エメット エドワード ジョン
イギリス アールジー４２ ６イーワイ バークシャー ブラックネル シンジェンタ ジーロズ ヒル
インターナショナル リサーチ センター シンジェンタ リミテッド内
- (72)発明者 デール スザンナ
イギリス アールジー４２ ６イーワイ バークシャー ブラックネル シンジェンタ ジーロズ ヒル
インターナショナル リサーチ センター シンジェンタ リミテッド内
- (72)発明者 マンズ ゴードン リチャード
イギリス アールジー４２ ６イーワイ バークシャー ブラックネル シンジェンタ ジーロズ ヒル
インターナショナル リサーチ センター シンジェンタ リミテッド内

F ターム (参考) 4H011 AB01 AC01 AC04 BA05 BA06 BB09 BB11 BC05 BC06 DA13
DD03 DE15