(19)日本国特許庁(JP)　(12)公表特許公報(A)　(11)公表番号
特表2024-541080
(P2024-541080A)
(43)公表日　令和6年11月6日(2024.11.6)

(51)国際特許分類		FI		テーマコード（参考）
C07D 403/04	*(2006.01)*	C07D	403/04	CSP　4H011
C07D 401/04	*(2006.01)*	C07D	401/04	
C07D 491/056	*(2006.01)*	C07D	491/056	
A01N 43/58	*(2006.01)*	A01N	43/58	E
A01P 13/00	*(2006.01)*	A01P	13/00	

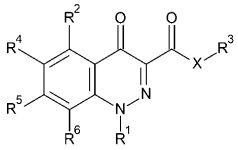
審査請求　未請求　予備審査請求　未請求　（全64頁）

(21)出願番号　特願2024-529217(P2024-529217)
(86)(22)出願日　令和4年11月15日(2022.11.15)
(85)翻訳文提出日　令和6年5月15日(2024.5.15)
(86)国際出願番号　PCT/EP2022/082045
(87)国際公開番号　WO2023/088921
(87)国際公開日　令和5年5月25日(2023.5.25)
(31)優先権主張番号　21208993.2
(32)優先日　令和3年11月18日(2021.11.18)
(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,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,MC,
最終頁に続く

(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 ４０５８ バーゼル ローゼンタールシュトラーセ ６７
(74)代理人　100103610
弁理士　▲吉▼田 和彦
(74)代理人　100109070
弁理士　須田 洋之
(74)代理人　100119013
弁理士　山崎 一夫
(74)代理人　100111796
弁理士　服部 博信
(74)代理人　100123766
弁理士　松田 七重
最終頁に続く

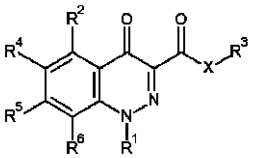
(54)【発明の名称】　除草性誘導体

(57)【要約】
式（Ｉ）の化合物
【化１】



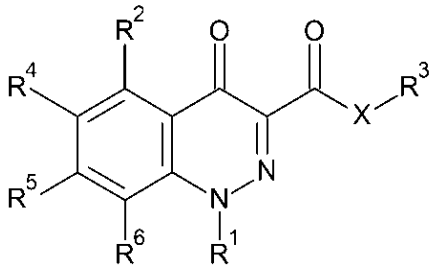
(I)

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



(I)

【特許請求の範囲】
【請求項１】
式（Ｉ）の化合物
【化１】

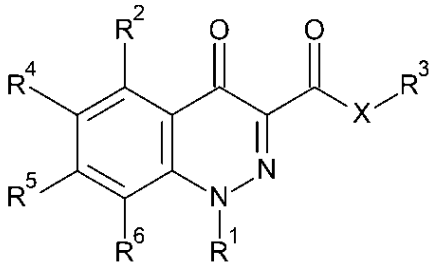


(I)

（式中、
Ｘは、Ｏ、ＮＲ^{7}又はＳであり；
Ｒ^{1}はヘテロアリールであり、前記ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個別に選択される１、２又は３個のヘテロ原子を含む５又は６員芳香族環であり、並びに、前記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いてもよい１、２、３又は４つの基で任意に置換されていてもよく；
Ｒ^{2}は、ハロゲン、シアノ、シアノＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルカルボニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニルオキシＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、－ＣＲ^{11}＝Ｎ－ＯＲ^{10}、ニトロ、Ｓ（Ｏ）$_{n}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ）$_{n}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル又はＳ（Ｏ）$_{n}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$シクロアルキルであり；
Ｒ^{3}は、水素、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$シクロアルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$シクロアルキルＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニル、フェニル又はフェニルＣ$_{1}$～Ｃ$_{3}$アルキルであり、前記フェニル部分は、Ｒ^{12}により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３又は４つの基で任意に置換されていてもよく；
Ｒ^{4}、Ｒ^{5}及びＲ^{6}は各々、水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルスルファニル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルスルフィニル及びＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルスルホニルから独立して選択され；
Ｒ^{7}は、水素、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{3}$アルキル又はＣ$_{1}$～Ｃ$_{3}$アルコキシであり；
Ｒ^{8}は、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルコキシ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルスルファニル若しくはＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルスルホニルであり；又は
いずれか２つの隣接するＲ^{8}基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、６員アリール環を形成し得、又は、いずれか２つの隣接するＲ^{8}基は、これらが結合する前記炭素原子と一緒になって、Ｏ及びＮから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５若しくは６員ヘテロシクリル環を形成し得、又は、いずれか２つの隣接するＲ^{8}基は、これらが結合する前記炭素原子と一緒になって、Ｏ及びＮから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５若しくは６員ヘテロアリール環を形成し得、並びに、前記アリール、ヘテロシクリル又はヘテロアリール環は、Ｒ^{9}により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３又は４つの基で任意に置換されていてもよく；
ｎは、０、１又は２であり；
Ｒ^{9}は、ハロゲン、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{3}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{3}$ハロアルキル又はＣ$_{1}$～Ｃ$_{3}$アルコキシであり；
Ｒ^{10}及びＲ^{11}は各々、水素及びＣ$_{1}$～Ｃ$_{3}$アルキルから独立して選択され；
Ｒ^{12}は、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{3}$アルキル又はＣ$_{1}$～Ｃ$_{3}$アルコキシである）

又は、その塩若しくはＮ－オキシド。
【請求項２】
R^1はヘテロアリールであり、前記ヘテロアリール部分は、Ｎ及びＳから個別に選択される１又は２個のヘテロ原子を含む５又は６員芳香族環であり、並びに、前記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いてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよい、請求項１に記載の化合物。
【請求項３】
R^1はヘテロアリールであり、前記ヘテロアリール部分は、１又は２個の窒素ヘテロ原子を含む６員芳香族環であり、及び、前記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いてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよい、請求項１又は請求項２に記載の化合物。
【請求項４】
R^2は、ハロゲン、シアノ、アセチル又はＮ－メトキシ－Ｃ－メチル－カルボンイミドイルである、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は水素又はC_1～C_3アルキルである、請求項１～４のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項６】
R^4、R^5及びR^6はすべて水素である、請求項１～５のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項７】
R^8は、ハロゲン、シアノ、C_1～C_4アルキル、C_1～C_4アルコキシ、C_1～C_3ハロアルキル、C_1～C_3ハロアルコキシ、C_1～C_3アルキルスルファニル若しくはC_1～C_3アルキルスルホニルであり；又は
いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する前記炭素原子と一緒になって、６員アリール環を形成し得、又は、いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する前記炭素原子と一緒になって、Ｏ及びＮから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５若しくは６員ヘテロシクリル環を形成し得、又は、いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する前記炭素原子と一緒になって、Ｏ及びＮから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５若しくは６員ヘテロアリール環を形成し得、並びに、前記ヘテロシクリル又はヘテロアリール環は、R^9により表される同一であっても異なっていてもよい１、２又は３つの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^8は、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシ若しくはC_1～C_3ハロアルキルであり；又は
いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する前記炭素原子と一緒になって、１又は２個の酸素原子を含む５又は６員ヘテロシクリル環を形成し得、及び、前記ヘテロシクリル環は、R^9により表される同一であっても異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよい、請求項１～７のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項９】
R^9はハロゲンである、請求項１～７のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１０】
Ｘは、Ｏである、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と、農学的に許容可能な配合助剤とを含む除草性組成物。
【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に記載の除草性組成物。
【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に記載の除草性組成物。
【請求項１４】
望ましくない植物の成長を防除する方法であって、望ましくない植物又はその生息地に、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性組成物を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、有効成分としての、除草活性を有する除草性シノリン誘導体に関する。本発明は、少なくとも１種のシノリン誘導体を含む農薬組成物、これらの化合物の調製プロセス及び特に有用な植物の作物において雑草を防除するための、農業又は園芸におけるシノリン誘導体又は組成物の使用にも関する。
【背景技術】
【０００２】
欧州特許第０２７３３２５号明細書、欧州特許第０２７４７１７号明細書、米国特許第５１８３８９１号明細書、国際公開第２０２１／２３３７８６号、及び国際公開第２０２１／２３３７８７号は、除草剤としてのシノリン誘導体を記載している。
【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）の化合物：
【化１】



(I)

（式中、
Ｘは、Ｏ、ＮＲ^{7}又はＳであり；
Ｒ^{1}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から個別に選択される１、２又は３個のヘテロ原子を含む５又は６員芳香族環であり、並びに、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又は異なっていてもよい１、２、３又は４つの基で任意に置換されていてもよく；
Ｒ^{2}は、ハロゲン、シアノ、シアノＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルカルボニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニルオキシＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、－ＣＲ^{11}＝Ｎ－ＯＲ^{10}、ニトロ、Ｓ（Ｏ）$_{n}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ）$_{n}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル又はＳ（Ｏ）$_{n}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$シクロアルキルであり；
Ｒ^{3}は、水素、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$シクロアルキル、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$シクロアルキルＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニル、フェニル又はフェニルＣ$_{1}$～Ｃ$_{3}$アルキルであり、フェニル部分は、Ｒ^{12}により表される同一であっても又は異なっていてもよい１、２、３又は４つの基で任意に置換されていてもよく；

R^4、R^5及びR^6は各々、水素、ハロゲン、シアノ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_1～C_6アルキルスルファニル、C_1～C_6アルキルスルフィニル及びC_1～C_6アルキルスルホニルから独立して選択され；

R^7は、水素、C_1～C_3アルキル又はC_1～C_3アルコキシであり；

R^8は、ハロゲン、シアノ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_1～C_6アルキルスルファニル若しくはC_1～C_6アルキルスルホニルであり；又は

いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、６員アリール環を形成し得、又は、いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、O及びNから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５若しくは６員ヘテロシクリル環を形成し得、又は、いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、O及びNから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５若しくは６員ヘテロアリール環を形成し得、並びに、アリール、ヘテロシクリル又はヘテロアリール環は、R^9により表される同一であっても又は異なっていてもよい１、２、３又は４つの基で任意に置換されていてもよく；

nは、０、１又は２であり；

R^9は、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3ハロアルキル又はC_1～C_3アルコキシであり；

R^{10}及びR^{11}は各々、水素及びC_1～C_3アルキルから独立して選択され；

R^{12}は、ハロゲン、シアノ、C_1～C_3アルキル又はC_1～C_3アルコキシである）

又は、その塩若しくはN－オキシドが提供されている。

【０００４】

意外なことに、式（Ｉ）の新規化合物は、実用的な目的のために、非常に有利なレベルの除草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、除草有効量の、本発明に係る式（Ｉ）の化合物を含む農薬組成物が提供される。このような農業用組成物は、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される希釈剤若しくはキャリアをさらに含み得る。

【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、例えば、１、２又は３つのR^8置換基といった同一の又は異なる置換基を１つ以上有していてもいなくてもよいことを意味する。例えば、１、２又は３つのハロゲンで置換されているC_1～C_6アルキルは、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基を含み得る。他の例としては、１、２又は３つのハロゲンで置換されているC_1～C_6アルコキシは、特に限定されないが、CH_2ClO－、$CHCl_2O$－、CCl_3O－、CH_2FO－、CHF_2O－、CF_3O－、CF_3CH_2O－又はCH_3CF_2O－基を含み得る。

【０００９】

本明細書において用いられる場合、「シアノ」及び「ニトリル」という用語は、－CN基を意味する。

【００１０】

本明細書において用いられる場合、「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】
本明細書において用いられる場合、「ヒドロキシ」という用語は、－ＯＨ基を意味する。
【００１２】
本明細書において用いられる場合、「アセチル」という用語は、－Ｃ（Ｏ）ＣＨ$_3$基を意味する。
【００１３】
本明細書において用いられる場合、「ニトロ」という用語は、ＮＯ$_2$基を意味する。
【００１４】
本明細書において用いられる場合、「Ｃ$_1$～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つの炭素原子を有し、且つ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$_1$～Ｃ$_4$アルキル」及び「Ｃ$_1$～Ｃ$_3$アルキル」は、相応に解釈されるべきである。Ｃ$_1$～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－プロピル及びこれらの異性体、例えばイソ－プロピルが挙げられる。「Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキレン」基とは、Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルキルの対応する定義を指すが、ただし、２つの単結合によって分子の残部に結合している基を除く。「Ｃ$_1$～Ｃ$_2$アルキレン」という用語は、相応に解釈されるべきである。Ｃ$_1$～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$_2$ＣＨ$_2$－及び－（ＣＨ$_2$）$_3$－が挙げられる。
【００１５】
本明細書において用いられる場合、「Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルキル」という用語は、同じであるか又は異なる１つ以上のハロゲン原子によって置換されている、上記において一般に定義されているＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル基を指す。「Ｃ$_1$～Ｃ$_4$ハロアルキル」及び「Ｃ$_1$～Ｃ$_3$ハロアルキル」という用語は、相応に解釈されるべきである。Ｃ$_1$～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、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル及び２，２，２－トリフルオロメチルが挙げられる。
【００１６】
本明細書において用いられる場合、「シアノＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル」という用語は、上記に定義されている１つ以上のシアノ基で置換されている、上記において一般に定義されているＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル基を指す。シアノＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキルの例としては、これらに限定されないが、２－シアノメチル及び２－シアノエチルが挙げられる。
【００１７】
本明細書において用いられる場合、「Ｃ$_1$～Ｃ$_6$ハロアルコキシ」という用語は、同じであるか又は異なる１つ以上のハロゲン原子によって置換されている、上記において一般に定義されているＣ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ基を指す。「Ｃ$_1$～Ｃ$_4$ハロアルコキシ」及び「Ｃ$_1$～Ｃ$_3$ハロアルコキシ」という用語は、相応に解釈されるべきである。Ｃ$_1$～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。
【００１８】
本明細書において用いられる場合、「Ｃ$_1$～Ｃ$_6$アルコキシ」という用語は、Ｒ$_a$が、上記において一般に定義されているＣ$_1$～Ｃ$_6$アルキル基である式－ＯＲ$_a$の基を指す。「Ｃ$_1$～Ｃ$_4$アルコキシ」及び「Ｃ$_1$～Ｃ$_3$アルコキシ」という用語は、相応に解釈されるべきである。Ｃ$_1$～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。
【００１９】
本明細書において用いられる場合、「Ｃ$_2$～Ｃ$_6$アルケニル」という用語は、炭素及び水素原子のみから構成され、（Ｅ）－又は（Ｚ）－立体配置のいずれかのものであり得る少なくとも１つの二重結合を含み、２～６つの炭素原子を有し、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$_2$～Ｃ$_3$アルケニル」という用語は、相応に解釈されるべきである。Ｃ$_2$～Ｃ$_6$アルケニルの例としては、これらに限

定されないが、エテニル（ビニル）、プロプ－１－エニル、プロプ－２－エニル（アリル）、及びブタ－１－エニルが挙げられる。

【００２０】

本明細書において用いる場合、「C_2～C_6アルキニル」という用語は、炭素及び水素原子のみから構成され、少なくとも１つの三重結合を含み、２～６つの炭素原子を有し、且つ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_2～C_3アルキニル」という用語は、相応に解釈されるべきである。C_2～C_6アルキニルの例としては、これらに限定されないが、エチニル、プロパ－１－イニル、及びブタ－１－イニルが挙げられる。

【００２１】

本明細書において用いられる場合、「C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキル」という用語は、式R_bOR_a－の基を指し、ここで、R_bは、上記において一般に定義されているC_1～C_6アルキル基であり、及びR_aは、上記において一般に定義されているC_1～C_6アルキレン基である。C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキルの例としては、これらに限定されないが、メトキシメチル、メトキシエチル及びエトキシメチルが挙げられる。

【００２２】

本明細書において用いられる場合、「C_3～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、３～６つの炭素原子を含有する基を指す。「C_3～C_5シクロアルキル」及び「C_3～C_4シクロアルキル」という用語は、相応に解釈されるべきである。C_3～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。

【００２３】

本明細書において用いられる場合、「C_3～C_6シクロアルキルC_1～C_6アルキル」という用語は、上記に定義されているC_1～C_6アルキレンリンカーにより分子の残部に結合しているC_3～C_6シクロアルキル環を指す。C_3～C_6シクロアルキルC_1～C_6アルキルの例としては、これらに限定されないが、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル及びシクロヘキシルメチルが挙げられる。

【００２４】

本明細書において用いられる場合、「C_1～C_6アルコキシC_2～C_6アルケニル」という用語は、式R_bOR_a－の基を指し、ここで、R_bは、上記において一般に定義されているC_1～C_6アルキル基であり、及びR_aは、上記において一般に定義されているC_1～C_6アルケン基である。C_1～C_6アルコキシC_2～C_6アルケニルの例としては、これらに限定されないが、１－メトキシビニル及び１－エトキシビニルが挙げられる。

【００２５】

本明細書において用いられる場合、「C_2～C_6アルケニルオキシC_1～C_6アルキル」という用語は、式R_bOR_a－の基を指し、ここで、R_bは、上記において一般に定義されているC_2～C_6アルケニル基であり、及びR_aは、上記において一般に定義されているC_1～C_6アルキレン基である。

【００２６】

本明細書において用いられる場合、「フェノキシ」という用語は、酸素原子を介して分子の残部に結合しているフェニル環を指す。

【００２７】

本明細書において用いられる場合、「フェニルC_1～C_3アルキル」という用語は、上記に定義されているC_1～C_3アルキレンリンカーにより分子の残部に結合しているフェニル環を指す。

【００２８】

本明細書において用いられるところ、「ヘテロアリール」という用語は、Ｎ、Ｏ及びＳから個別に選択される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。ヘテロアリール基は、炭素原子又はヘテロ原子を介して分子の残部に結合し得る。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、ベンゾフラニル

、チオフェニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾリル、ベンズイミダゾリル、オキサジアゾリル、ピリジル、ピロリル、キノリニル、イソキノリニル、インドリル、イソインドリル、インダゾリル、ピラゾリル、チアゾリル、オキサゾリル、ベンゾオキサゾリル、ピリダジニル、シノリニル、ピリミジニル及びキナゾリニルが挙げられる。

【００２９】

本明細書において用いられる場合、「C_1～C_6アルキルカルボニル」という用語は、式－Ｃ（Ｏ）R_aの基を指し、ここで、R_aは、上記において一般に定義されているC_1～C_6アルキル基である。

【００３０】

本明細書において用いられる場合、「C_1～C_6アルキルスルファニル」という用語は、R_aが、上記において一般に定義されているC_1～C_6アルキル基である式－ＳR_aの基を指す。「C_1～C_4アルキルスルファニル」及び「C_1～C_3アルキルスルファニル」という用語は、相応に解釈されるべきである。C_1～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。

【００３１】

本明細書において用いられる場合、「C_1～C_6アルキルスルフィニル」という用語は、R_aが、上記において一般に定義されているC_1～C_6アルキル基である式－Ｓ（Ｏ）R_aの基を指す。「C_1～C_4アルキルスルフィニル」及び「C_1～C_3アルキルスルフィニル」という用語は、相応に解釈されるべきである。C_1～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。

【００３２】

本明細書において用いられる場合、「C_1～C_6アルキルスルホニル」という用語は、R_aが、上記において一般に定義されているC_1～C_6アルキル基である式－Ｓ（Ｏ）$_2R_a$の基を指す。「C_1～C_4アルキルスルホニル」及び「C_1～C_3アルキルスルホニル」という用語は、相応に解釈されるべきである。C_1～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、メチルスルホニルが挙げられる。

【００３３】

式（Ｉ）の化合物中に１つ以上の立体中心要素の存在が可能であるとは、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、単結合に係る回転の制限によってアストロプ異性体が生じ得る。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。各事例において、本発明に係る式（Ｉ）の化合物は、遊離形態、Ｎ－オキシドとしての酸化型又は例えば農学的に使用可能な塩形態といった塩形態である。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、アルカリ金属塩基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共に形成し得る塩が好ましい。Ｎ－オキシドは、第三級アミンの酸化型又は窒素含有芳香族複素環式化合物の酸化型である。これらは、例えば、書籍“Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ Ｎ－ｏｘｉｄｅｓ”，Ａ．Ａｌｂｉｎｉ ａｎｄ Ｓ．Ｐｉｅｔｒａ，ＣＲＣ Ｐｒｅｓｓ，Ｂｏｃａ Ｒａｔｏｎ（１９９１）に記載されている。

【００３４】

以下のリストは、式（Ｉ）の化合物に関する置換基Ｘ、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6、R^7、ｎ、R^8、R^9、R^{10}、R^{11}、及びR^{12}についての好ましい定義を含む定義を提供する。これらの置換基のいずれか１つについて、以下に示される定義のいずれかが、以下又は本明細書の他の箇所に示されるいずれかの他の置換基のいずれかの定義と組み合わされ得る。

【００３５】

Ｘは、Ｏ、ＮＲ^{7}又はＳである。実施形態の１つの組において、Ｘは、Ｏである。実施形態の他の組において、Ｘは、Ｓである。実施形態のさらなる組において、Ｘは、ＮＲ^{7}である。

【００３６】

Ｒ^{1}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から個別に選択される１、２又は３個のヘテロ原子を含む５又は６員芳香族環であり、並びに、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又は異なっていてもよい１、２、３又は４つの基で任意に置換されていてもよい。好ましくは、Ｒ^{1}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から個別に選択される１、２又は３個のヘテロ原子を含む５又は６員芳香族環であり、並びに、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又は異なっていてもよい１、２又は３つの基で任意に置換されていてもよい。より好ましくは、Ｒ^{1}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から個別に選択される１、２又は３個のヘテロ原子を含む５又は６員芳香族環であり、並びに、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又は異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよい。さらにより好ましくは、Ｒ^{1}はヘテロアリールであり、ヘテロアリール部分は、Ｎ及びＳから個別に選択される１又は２個のヘテロ原子を含む５又は６員芳香族環であり、並びに、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又は異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよい。さらにより好ましくは、Ｒ^{1}はヘテロアリールであり、ヘテロアリール部分は、１又は２個の窒素ヘテロ原子を含む６員芳香族環であり、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又は異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよい。

【００３７】

一実施形態においては、Ｒ^{1}はピリジル又はピリミジニルであり、各ピリジル又はピリミジニル部分は、Ｒ^{8}により表される同一であっても又は異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよい。他の実施形態において、Ｒ^{1}はピリジル又はピリミジニルであり、各ピリジル部分は、Ｒ^{8}により表される同一であっても又は異なっていてもよい１又は２つの基で置換されている。

【００３８】

Ｒ^{2}は、ハロゲン、シアノ、シアノＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルカルボニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルキニル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニルオキシＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、－ＣＲ^{11}＝Ｎ－ＯＲ^{10}、ニトロ、Ｓ（Ｏ）$_{n}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ）$_{n}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$ハロアルキル又はＳ（Ｏ）$_{n}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$シクロアルキルである。好ましくは、Ｒ^{2}は、ハロゲン、シアノ、シアノＣ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$ハロアルキル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルカルボニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{4}$アルケニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{4}$アルキニル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニル、Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{4}$アルケニルオキシＣ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル、－ＣＲ^{11}＝Ｎ－ＯＲ^{10}、ニトロ、Ｓ（Ｏ）$_{n}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキル、Ｓ（Ｏ）$_{n}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$ハロアルキル又はＳ（Ｏ）$_{n}$Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{6}$シクロアルキルである。より好ましくは、Ｒ^{2}は、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルカルボニル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルコキシＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニル、－ＣＲ^{11}＝Ｎ－ＯＲ^{10}又はＳ（Ｏ）$_{n}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルである。さらにより好ましくは、Ｒ^{2}は、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキルカルボニル、Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルコキシＣ$_{2}$～Ｃ$_{4}$アルケニル、－ＣＲ^{11}＝Ｎ－ＯＲ^{10}又はＳ（Ｏ）$_{2}$Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキルである。

【００３９】

一組の実施形態において、Ｒ^{2}は、ハロゲン、シアノ、アセチル、１－メトキシビニル、１－エトキシビニル、メチルスルホニル又はＮ－メトキシ－Ｃ－メチル－カルボンイミドイルである。実施形態の他の組において、Ｒ^{2}は、ハロゲン、シアノ、アセチル又はＮ－メトキシ－Ｃ－メチル－カルボンイミドイルである。実施形態のさらなる組において、Ｒ^{2}は、ブロモ、シアノ、アセチル、又はＮ－メトキシ－Ｃ－メチル－カルボンイミドイルである。実施形態のさらなる組において、Ｒ^{2}はハロゲン又はシアノであり、好ましく

は、ブロモ又はシアノである。

【００４０】

R^3は、水素、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルC_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキニル、フェニル又はフェニルC_1～C_3アルキルであり、フェニル部分は、R^{12}により表される同一であっても又は異なっていてもよい１、２、３又は４つの基で任意に置換されていてもよい。好ましくは、R^3は、水素、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルC_1～C_3アルキル、C_1～C_4アルコキシC_1～C_3アルキル、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキニル、フェニル又はフェニルC_1～C_2アルキルであり、フェニル部分は、R^{12}により表される、同一であっても又は異なっていてもよい１、２又は３つの基で任意に置換されていてもよい。より好ましくは、R^3は、水素、C_1～C_6アルキル、C_1～C_4ハロアルキル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルC_1～C_3アルキル、C_1～C_4アルコキシC_1～C_3アルキル、フェニル又はベンジルであり、フェニル部分は、R^{12}により表される同一であっても又は異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよい。さらにより好ましくは、R^3は水素又はC_1～C_4アルキルである。さらにより好ましくは、R^3は水素又はC_1～C_3アルキルである。R^3が水素、メチル又はエチルである場合が特に好ましい。一組の実施形態において、R^3は水素又はエチルである。

【００４１】

R^4、R^5及びR^6は各々、水素、ハロゲン、シアノ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_1～C_6アルキルスルファニル、C_1～C_6アルキルスルフィニル及びC_1～C_6アルキルスルホニルから独立して選択される。好ましくは、R^4、R^5及びR^6は各々、水素、ハロゲン、シアノ、C_1～C_4アルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_1～C_3ハロアルキル、C_1～C_3ハロアルコキシ、C_1～C_3アルキルスルファニル、C_1～C_3アルキルスルフィニル及びC_1～C_3アルキルスルホニルから独立して選択される。より好ましくは、R^4、R^5及びR^6は各々、水素、フルオロ、ブロモ、シアノ、C_1～C_4アルキル、メトキシ、エトキシ、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及びメチルスルホニルから独立して選択される。さらにより好ましくは、R^4、R^5及びR^6は各々、水素、フルオロ、ブロモ、シアノ、メチル、イソブチル、メトキシ及びトリフルオロメチルから独立して選択される。さらにより好ましくは、R^4、R^5及びR^6は各々、水素、フルオロ、ブロモ、シアノ、メチル、イソブチル、メトキシ及びトリフルオロメチルから独立して選択される。実施形態の好ましい組において、R^4、R^5及びR^6はすべて水素である。

【００４２】

R^7は、水素、C_1～C_3アルキル又はC_1～C_3アルコキシである。好ましくは、R^7は、水素、メチル又はメトキシである。より好ましくは、R^7は水素である。

【００４３】

R^8は、ハロゲン、シアノ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_1～C_6アルキルスルファニル若しくはC_1～C_6アルキルスルホニルであり；又は

いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、６員アリール環を形成し得、又は、いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、O及びNから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５若しくは６員ヘテロシクリル環を形成し得、又は、いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、O及びNから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５若しくは６員ヘテロアリール環を形成し得、並びに、アリール、ヘテロシクリル又はヘテロアリール環は、R^9により表される同一であっても又は異なっていてもよい１、２、３又は４つの基で任意に置換されていてもよい。

【００４４】

好ましくは、R^8は、ハロゲン、シアノ、C_1～C_4アルキル、C_1～C_4アルコキシ、C_1～C_3ハロアルキル、C_1～C_3ハロアルコキシ、C_1～C_3アルキルスルファニル若しくはC_1～C_3アルキルスルホニルであり；又は

いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、６員アリール環を形成し得、又は、いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、O及びNから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５若しくは６員ヘテロシクリル環を形成し得、又は、いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、O及びNから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５若しくは６員ヘテロアリール環を形成し得、並びに、ヘテロシクリル又はヘテロアリール環は、R^9により表される同一であっても又は異なっていてもよい１、２又は３つの基で任意に置換されていてもよい。

【００４５】

より好ましくは、R^8は、ハロゲン、シアノ、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_1～C_3ハロアルキル、C_1～C_3ハロアルコキシ若しくはC_1～C_3アルキルスルファニルであり；又は

いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、６員アリール環を形成し得、又は、いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、１若しくは２個の酸素原子を含む５若しくは６員ヘテロシクリル環を形成し得、又は、いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、１若しくは２個の窒素原子を含む５若しくは６員ヘテロアリール環を形成し得、及び、ヘテロシクリル又はヘテロアリール環は、R^9により表される同一であっても又は異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよい。

【００４６】

さらにより好ましくは、R^8は、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシ若しくはC_1～C_3ハロアルキルであり；又は

いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、１又は２個の酸素原子を含む５又は６員ヘテロシクリル環を形成し得、及び、ヘテロシクリル環は、R^9により表される同一であっても又は異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよい。

【００４７】

さらにより好ましくは、R^8は、クロロ、ブロモ、フルオロ、メチル、メトキシ若しくはトリフルオロメチルであり；又は、いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、２個の酸素原子を含む５員ヘテロシクリル環を形成し得、及び、ヘテロシクリル環は２個のフルオロ基で置換されている。

【００４８】

一組の実施形態において、R^8は、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_1～C_3ハロアルキル若しくはC_1～C_3ハロアルコキシ；又は、ジフルオロメトキシであり；又は、いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、２個の酸素原子を含む５員ヘテロシクリル環を形成し得、及び、ヘテロシクリル環は２個のフルオロ基で置換されている。

【００４９】

実施形態の他の組において、R^8は、ハロゲン、メチル、メトキシ、ジフルオロメチル若しくはジフルオロメトキシであり；又は、いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、２個の酸素原子を含む５員ヘテロシクリル環を形成し得、及び、ヘテロシクリル環は２個のフルオロ基で置換されている。

【００５０】

R^9は、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3ハロアルキル又はC_1～C_3アルコキシである。好ましくは、R^9は、ハロゲン、シアノ、メチル又はメトキシである。より好ましくは、R^9は、ハロゲン、メチル又はメトキシである。さらにより好ましくは、R^9はハロゲンである。さらにより好ましくは、R^9はフルオロである。

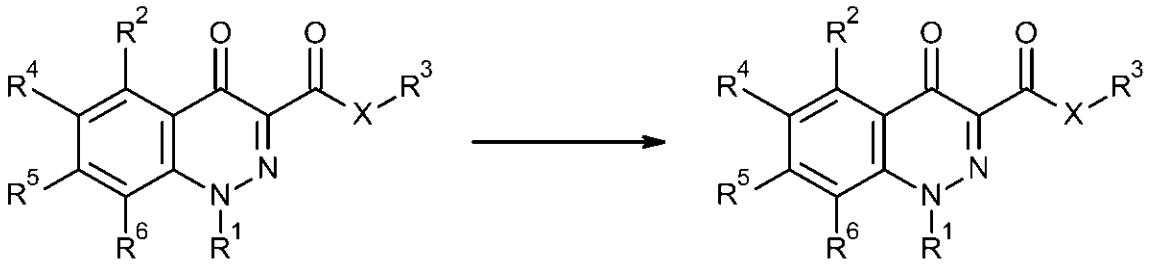
【００５１】
R^{10}及びR^{11}は各々、水素及びC_1～C_3アルキルから独立して選択される。好ましくは、R^{10}及びR^{11}は各々、水素、メチル及びエチルから独立して選択される。一組の実施形態において、R^{10}及びR^{11}は共にメチルである。
【００５２】
R^{12}は、ハロゲン、シアノ、C_1～C_3アルキル又はC_1～C_3アルコキシである。好ましくは、R^{12}は、ブロモ、クロロ、フルオロ、シアノ、メチル又はメトキシである。
【００５３】
ｎは、０、１又は２である。一組の実施形態において、ｎは０又は２である。実施形態の他の組においてｎは０である。実施形態のさらなる組においてｎは１である。実施形態のさらなる組において、ｎは２である。
【００５４】
本発明に係る式（Ｉ）の化合物において、好ましくは：
ＸはＯ、NR^7であり；
R^1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から個別に選択される１又は２個のヘテロ原子を含む５又は６員芳香族環であり、並びに、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又は異なっていてもよい１、２又は３つの基で任意に置換されていてもよく；
R^2はブロモ又はシアノであり；
R^3は水素又はC_1～C_3アルキルであり；
R^4、R^5及びR^6はすべて水素であり；
R^7は水素、C_1～C_3アルキルであり；並びに
R^8は、ハロゲン、シアノ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_1～C_6アルキルスルファニル若しくはC_1～C_6アルキルスルホニルであり；又は
いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、６員アリール環を形成し得、又は、いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、Ｏ及びＮから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５若しくは６員ヘテロシクリル環を形成し得、又は、いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、Ｏ及びＮから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５若しくは６員ヘテロアリール環を形成し得、並びに、アリール、ヘテロシクリル又はヘテロアリール環は、R^9により表される、同一であっても又は異なっていてもよい１、２又は３つの基で任意に置換されていてもよく；並びに
R^9はハロゲンである。
【００５５】
実施形態の他の組において、ＸはＯであり；
R^1はヘテロアリールであり、ヘテロアリール部分は１又は２個の窒素原子を含む６員芳香族単環式環であり、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又は異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されていてもよく；
R^2はブロモ又はシアノであり；
R^3は、水素、メチル又はエチルであり；
R^4、R^5及びR^6はすべて水素であり；
R^8は、ハロゲン、メチル、メトキシ若しくはトリフルオロメチルであり；又は
いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、２個の酸素原子を含む５員ヘテロシクリル環を形成し得、及び、ヘテロシクリル環は２個のフルオロ基で置換されている。
【００５６】
実施形態のさらなる組において、ＸはＯであり；
R^1はピリジル又はピリミジニルであり、各ピリジル又はピリミジニル部分は、R^8により表される同一であっても又は異なっていてもよい１又は２つの基で任意に置換されて

いてもよく；
　R^2は、ブロモ、シアノ、アセチル又はＮ－メトキシ－Ｃ－メチル－カルボンイミドイルであり；
　R^3は水素又はエチルであり；
　R^4、R^5及びR^6はすべて水素であり；
　R^8は、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_1～C_3ハロアルキル若しくはC_1～C_3ハロアルコキシであり；又は
　いずれか２つの隣接するR^8基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、２個の酸素原子を含む５員ヘテロシクリル環を形成し得、及び、ヘテロシクリル環は２個のフルオロ基で置換されている。

【００５７】
　好ましくは、式（Ｉ）の化合物は：
　５－シアノ－４－オキソ－１－ピリミジン－５－イル－シノリン－３－カルボン酸（化合物１）；
　エチル５－ブロモ－１－（２－クロロ－４－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物３）；
　エチル５－ブロモ－１－（６－メトキシ－３－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物４）；
　エチル５－ブロモ－１－（５－クロロ－３－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物５）；
　エチル５－ブロモ－１－（２－メトキシ－４－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物９）；
　エチル５－ブロモ－１－（２－ブロモ－４－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物１０）；
　エチル５－シアノ－１－（６－フルオロ－３－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物１１）；
　エチル５－ブロモ－１－（６－フルオロ－３－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物２３）；
　エチル５－ブロモ－１－（２，２－ジフルオロ－［１，３］ジオキソロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物２４）；
　エチル５－ブロモ－１－（６－クロロ－５－メチル－３－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物２６）；
　エチル５－ブロモ－１－（６－メトキシ－５－メチル－３－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物２９）；
　エチル５－ブロモ－１－［６－（ジフルオロメチル）－３－ピリジル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物３０）；
　エチル５－ブロモ－１－（６－メトキシピリミジン－４－イル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物３２）；
　エチル５－ブロモ－１－（５－クロロ－３－シアノ－２－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物３３）；
　エチル５－シアノ－１－［６－（ジフルオロメトキシ）－３－ピリジル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物３５）；
　エチル５－ブロモ－１－［６－（ジフルオロメトキシ）－３－ピリジル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物３６）；
　エチル５－アセチル－１－［６－（ジフルオロメトキシ）－３－ピリジル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物３７）；
　エチル５－ブロモ－１－［２－（ジフルオロメトキシ）－４－ピリジル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物３８）；
　エチル５－アセチル－１－［２－（ジフルオロメトキシ）－４－ピリジル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物４０）；及び

エチル１－［２－（ジフルオロメトキシ）－４－ピリジル］－５－［（Ｚ）－Ｎ－メトキシ－Ｃ－メチル－カルボンイミドイル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物４１）
から選択される。
【００５８】
より好ましくは、式（Ｉ）の化合物は：
５－シアノ－４－オキソ－１－ピリミジン－５－イル－シノリン－３－カルボン酸（化合物１）；
エチル５－ブロモ－１－（２－クロロ－４－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物３）；
エチル５－ブロモ－１－（６－メトキシ－３－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物４）；
エチル５－ブロモ－１－（５－クロロ－３－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物５）；
エチル５－ブロモ－１－（２－ブロモ－４－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物１０）；
エチル５－シアノ－１－（６－フルオロ－３－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物１１）；
エチル５－ブロモ－１－（６－フルオロ－３－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物２３）；
エチル５－ブロモ－１－（２，２－ジフルオロ－［１，３］ジオキソロ［４，５－ｂ］ピリジン－６－イル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物２４）；
エチル５－ブロモ－１－（６－クロロ－５－メチル－３－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物２６）；
エチル５－ブロモ－１－（６－メトキシ－５－メチル－３－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物２９）；
エチル５－ブロモ－１－［６－（ジフルオロメチル）－３－ピリジル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物３０）；
エチル５－ブロモ－１－［６－（ジフルオロメトキシ）－３－ピリジル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物３６）；
エチル５－アセチル－１－［６－（ジフルオロメトキシ）－３－ピリジル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物３７）；
エチル５－ブロモ－１－［２－（ジフルオロメトキシ）－４－ピリジル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物３８）；
エチル５－アセチル－１－［２－（ジフルオロメトキシ）－４－ピリジル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物４０）；及び
エチル１－［２－（ジフルオロメトキシ）－４－ピリジル］－５－［（Ｚ）－Ｎ－メトキシ－Ｃ－メチル－カルボンイミドイル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物４１）
から選択される。
【００５９】
本発明の化合物は、以下のスキームに示されているとおりに製造することが可能であり、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を以下に示す。文章中に別段の定めがある場合を除き、Ｘ、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5及びR^6は、本明細書中で上記において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た出発材料は、通常の商業的な供給者から購入され得るか、又は公知の方法により調製され得る。出発材料及び中間体は、クロマトグラフィ、結晶化、蒸留及びろ過などの先行技術における方法論により、次のステップにおいて用いられる前に精製され得る。
【００６０】

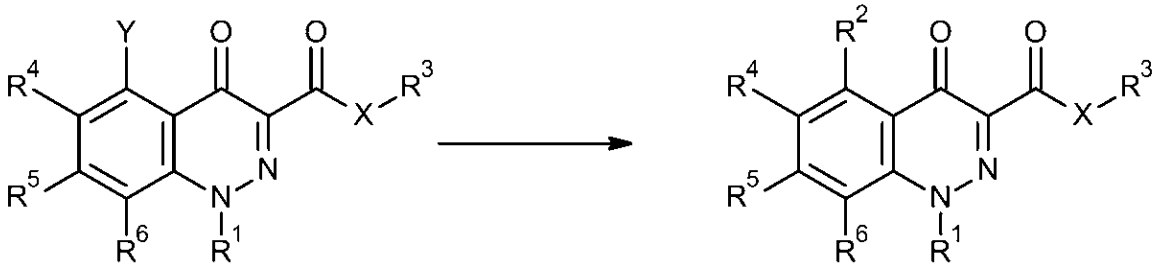
スキーム１：
【化２】



式（Ｉ）　　式（Ｉ）

式（Ｉ）の化合物（式中、Ｘは、酸素であり、及びＲ^{3}は、水素である）は、任意の共溶剤（水など）を伴う好適な溶剤（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、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（Ｉ）の化合物（式中、Ｘは、酸素であり、及びＲ^{3}は、水素ではなく、上記に定義されているいずれかの他のＲ^{3}基である）の加水分解により調製され得る。これは、上記のスキーム１に示されている。式（Ｉ）の化合物は、以下に記載の方法によっても調製され得る。

【００６１】
スキーム２：
【化３】

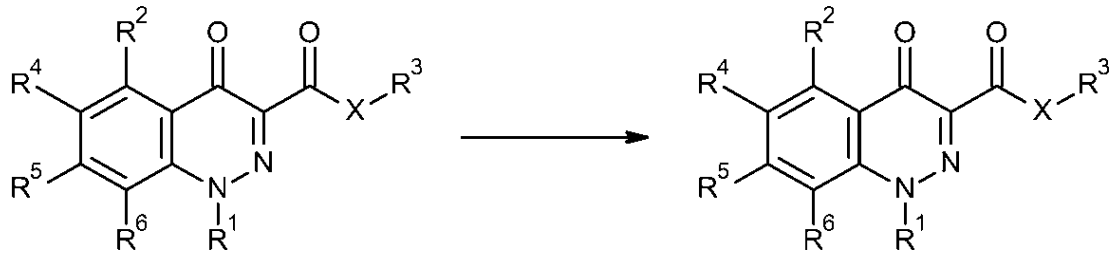


式（Ｂ）　　式（Ｉ）

式（Ｉ）の化合物は、ＹがＣｌ、Ｂｒ又はＩである式（Ｂ）の化合物からも調製され得る。本発明の実施形態において、Ｒ^{2}がC_{2}～C_{6}アルケニルオキシであり、及びＹがＢｒである場合、式（Ｉ）の化合物は、パラジウム触媒（ジクロロビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム）又はジクロロ（１，１’－ビス（ジフェニルホスファニル）フェロセン）パラジウム（ｌｌ）ジクロロメタン付加物など）の存在下において、塩基（トリエチルアミンなど）を伴うか又は伴わずに、好適な有機溶剤（トルエン、１，４－ジオキサン又はＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミドなど）中、高い反応温度（例えば、１２０℃）におけるスタナン試薬との反応によるスティル反応で調製され得る。これは、上記のスキーム２に示されている。

【００６２】
スキーム３：

【化４】



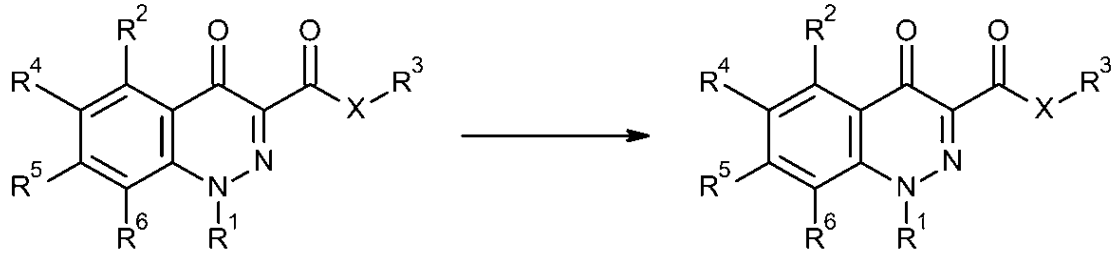
式（Ｉ）　　式（Ｉ）

その後の変換において、Ｒ^{2}がＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルカルボニルである式（Ｉ）の化合物は、Ｒ^{2}がＣ$_{2}$～Ｃ$_{6}$アルケニルオキシである式（Ｉ）の化合物から加水分解反応によって調製され得る。典型的には、この反応は、任意に好適な有機溶剤（アセトン、１，４－ジオキサン又はテトラヒドロフランなど）中及び好適な温度（２０℃～６０℃）における水性の酸（塩酸など）による処理によって行われる。これは、上記のスキーム３に示されている。

【００６３】

スキーム４：

【化５】



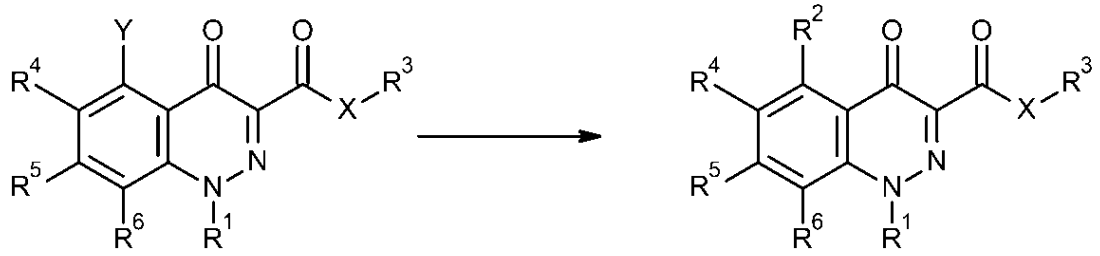
式（Ｉ）　　式（Ｉ）

さらなる変換において、Ｒ^{2}が－ＣＲ^{11}＝Ｎ－ＯＲ^{10}である式（Ｉ）の化合物は、Ｒ^{2}がＣ$_{1}$～Ｃ$_{6}$アルキルカルボニルである式（Ｉ）の化合物から、好適なヒドロキシルアミン化合物を伴う縮合反応により調製され得る。典型的には、この反応は、遊離塩基又は塩酸塩としての式「Ｈ$_{2}$ＮＯＲ^{10}」の化合物を伴って、塩基（酢酸ナトリウム、ピリジン又は水性水酸化カリウムなど）の添加を伴うか又は伴わずに、好適な有機溶剤（エタノール、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジメチルエーテル又はメタノールなど）中、追加の水伴うか又は伴わずに高温で行われる。これは、上記のスキーム４に示されている。

【００６４】

スキーム５：

【化６】



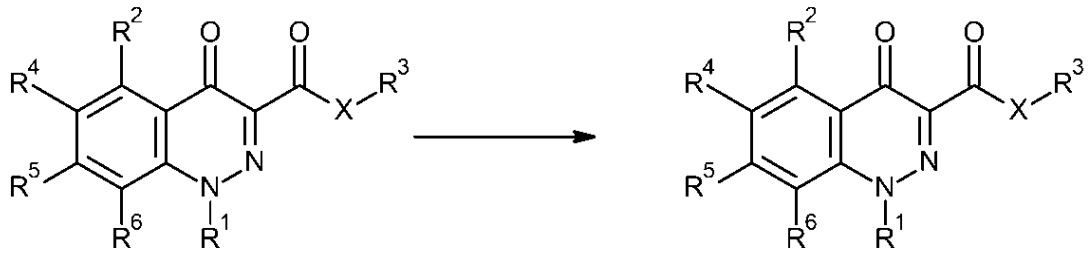
式（Ｂ） 式（Ｉ）

他の変換において、ＹがＢｒである式（Ｂ）の化合物は、公知の文献に記載の条件と同様に根岸カップリング条件下において、R^2がニトリルである式（Ｉ）の化合物に転換され得る。典型的には、この反応は、好適な触媒（ジクロロビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム）、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム、ジクロロ（１，１’－ビス（ジフェニルホスファニル）フェロセン）パラジウム（ｌｌ）ジクロロメタン付加物など）又は任意にリガンド（２－ジシクロヘキシルホスフィノ－２’，６’－ジメトキシビフェニルなど）を有する二酢酸パラジウムの存在下、好適な有機溶剤（ジメチルホルムアミドなど）中、高温における式（Ｂ）の化合物とジシアノ亜鉛との反応により行われる。これは、上記のスキーム５に示されている。

【００６５】

スキーム６：

【化７】



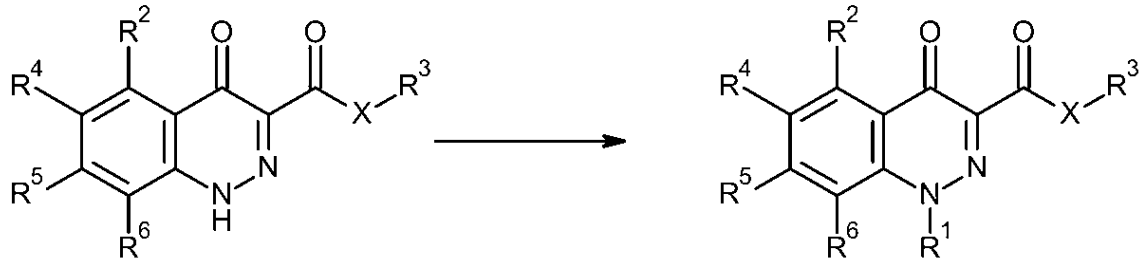
式（Ｉａ） 式（Ｉ）

他の変換において、式（Ｉａ）の化合物（式中、R^2はＢｒ又はＣＮであり、及び、R^1は水素である）は、公知の文献による条件と同様にS_NAr条件下におけるハロゲン化ヘテロアリールとの反応で、式（Ｉ）の化合物（式中、R^1はヘテロアリールである）に転換し得る。典型的には、この反応は、塩基（炭酸カリウムなど）の存在下、有機溶剤（ジメチルアセタミド又はＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミドなど）中、高温（１００℃～１７０℃など）で実施される。これは上記のスキーム６に示されている。

【００６６】

スキーム７：

【化８】



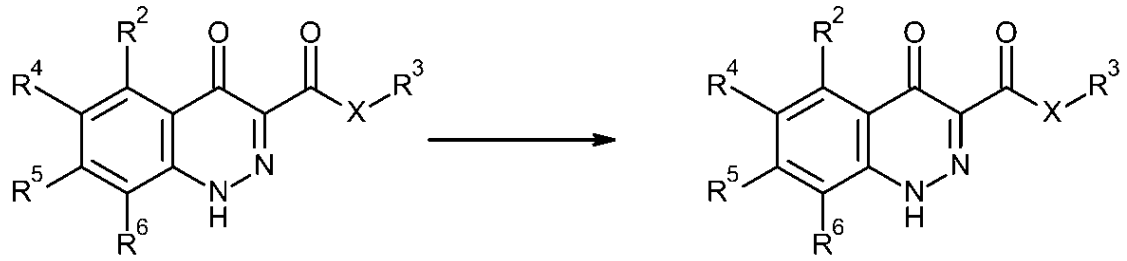
式（Ｉａ）　　式（Ｉ）

他の変換において、式（Ｉａ）の化合物は、標準的な文献による条件を用いるＣｈａｎ Ｌａｍクロスカップリング反応で、式（Ｉ）の化合物（式中、R^1はヘテロアリールである）に転換し得る。典型的には、この反応は、好適な銅触媒（酢酸銅（ＩＩ）など）の存在下、任意に、塩基（トリエチルアミン、ピリジン、Ｎ，Ｎ－ジエチルエタンアミン又は炭酸ナトリウムなど）の存在下、好適な有機溶剤（アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、ジクロロエタン又はトルエンなど）中、任意に、圧縮空気流中に、又は、追加の酸化剤（ボロン酸、ピリジンＮ－オキシド又はジ－ｔｅｒｔ－ブチルパーオキシドなど）の存在下における式（Ｉａ）の化合物と、R^1－ボロン酸又はボロキシンとの反応により実施される。これは、上記のスキーム７に示されている。

【００６７】

スキーム８：

【化９】



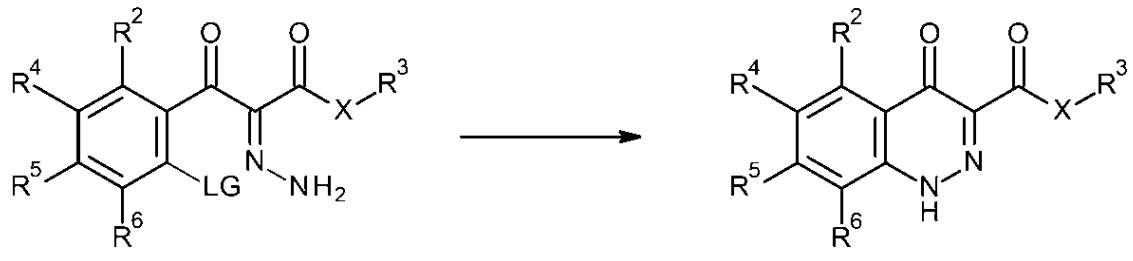
式（Ｉａ）　　式（Ｉａ）

異なる変換において、式（Ｉａ）の化合物（式中、R^2はＢｒである）は、文献に記載の条件を用いる金属触媒クロスカップリング手法により、式（Ｉａ）の化合物（式中、R^2はＣＮである）に転換し得る。これは、上記のスキーム８に示されている。

【００６８】

スキーム９：

【化１０】



式（Ｃ－ａ）　　式（Ｉａ）

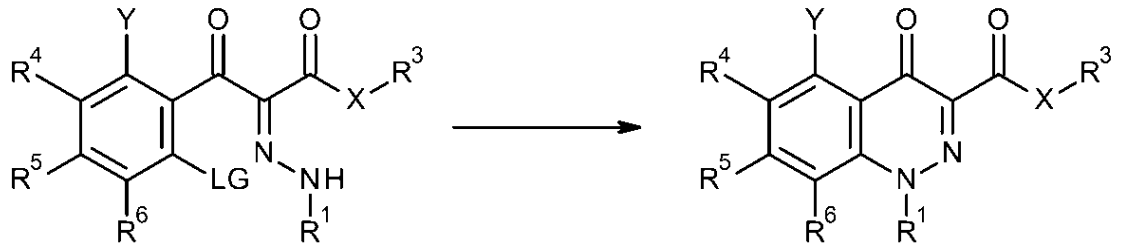
式（Ｉａ）の化合物は、好適な溶剤（ビス（２－メトキシエチル）エーテル、１，４－

ジオキサン、テトラヒドロフラン又はＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミドなど）中、高温（例えば、１５０℃）における塩基（例えば、水素化ナトリウムといった金属水素化物又は炭酸カリウムなど）による処理によって、又は塩基の不存在下で、式（Ｃ－ａ）（式中、ＬＧは、好適な脱離基（Ｆ、Ｃｌ又はＢｒなど）である）の化合物から調製され得る。これは、上記のスキーム９に示されている。

【００６９】

スキーム１０：

【化１１】



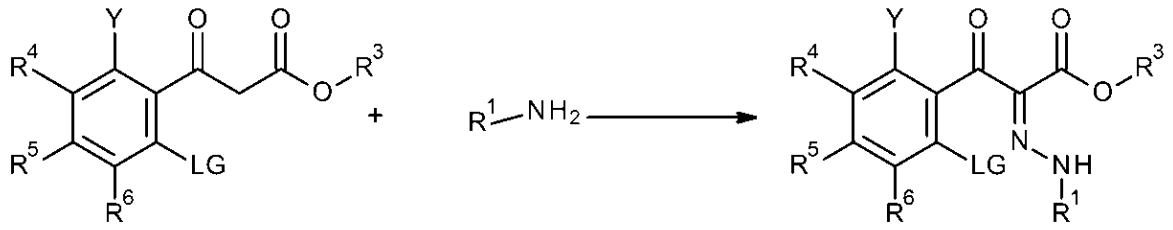
式（Ｃ）　　式（Ｂ）

式（Ｂ）の化合物（式中、Ｙは、Ｂｒであり、Ｘは、Ｏであり、及びＬＧは、好適な脱離基（Ｆ、Ｃｌ又はＢｒなど）である）は、好適な溶剤（１，４－ジオキサン、テトラヒドロフラン又はＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミドなど）中、高温（例えば、１００℃）における塩基（例えば、水素化ナトリウムといった金属水素化物又は炭酸カリウムなど）による処理によって式（Ｃ）の化合物から調製され得る。これは、上記のスキーム１０に示されている。

【００７０】

スキーム１１：

【化１２】



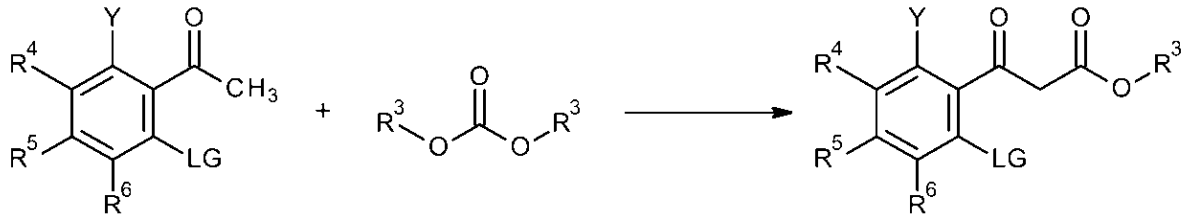
式（Ｄ）　　式（Ｅ）　　式（Ｃ）

式（Ｃ）の化合物（式中、Ｙは、Ｂｒであり、及びＬＧは、好適な脱離基（Ｆ、Ｃｌ又はＢｒなど）である）は、式（Ｄ）のβ－ケトエステルとアレーンジアゾニウム塩との反応から調製され得る。アレーンジアゾニウム塩は、酸（塩酸など）の存在下、水中における亜硝酸ナトリウムによる式（Ｅ）のアニリンのジアゾ化、これに続く、好適な塩基（酢酸ナトリウム若しくは酢酸カリウム又は炭酸カリウムなど）の存在下、好適な溶剤（水、メタノール又はエタノール）中、０℃～２５℃の温度における式（Ｄ）の化合物との反応により、インサイチューで調製可能である。式（Ｅ）の化合物は、市販されているか、又は当業者によく知られている方法により調製され得る。これは、スキーム１１において上記に示されている。

【００７１】

スキーム１２：

【化１３】



式（Ｆ）　　式（Ｇ）　　式（Ｄ）

式（Ｄ）のジカルボニル化合物（式中、Ｙは、Ｂｒであり、ＬＧは、好適な脱離基（Ｆ、Ｃｌ又はＢｒなど）である）は、好適な溶剤（テトラヒドロフラン、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、トルエン又は１，４－ジオキサンなど）中における、好適な塩基（カリウムｔ－ブトキシド又は水素化ナトリウムなど）によるメチルケトンの処理、これに続く、０℃～１１０℃の温度における、炭酸エステル（炭酸ジメチル又は炭酸ジエチルなど）との混合物の反応によるクライゼン縮合を介して、式（Ｆ）のメチルケトン化合物及び式（Ｇ）のジエステルから調製され得る。式（Ｆ）及び式（Ｇ）の化合物は、市販されているか、又は当業者によく知られている方法により調製され得る。これは、スキーム１２において上記に示されている。

【００７２】

本発明は、生息地において雑草を防除する方法をさらに提供し、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。また、本発明は、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さらに提供し得、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、望ましくない植物（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になる領域を意味する。適用は、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、本発明の化合物は、作物の発芽後に、生息地に適用される。いくつかの作物植物は、式（Ｉ）の化合物の除草効果に対して先天的に耐性を有し得る。

【００７３】

式（Ｉ）の化合物の適用量は、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；耕耘適用なし等）、作物植物、防除されるべき雑草、卓越的気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、１０～２５００ｇ／ｈａ、特に２５～１０００ｇ／ｈａ、特に２５～２５０ｇ／ｈａの量で適用される。

【００７４】

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）、滴下又は潅注などの他の方法も使用可能である。

【００７５】

「有用な植物」という用語は、従来の交配又は遺伝子操作方法により、ブロモキシニルのような除草剤又はある分類の除草剤、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）抑制剤、ＡＬＳ抑制剤、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）抑制剤、グルタミンシンテターゼ（ＧＳ）抑制剤又はプロトポルフィリノーゲン－オキシダーゼ（ＰＰＯ）抑制剤などに対する耐性がもたらされた有用な植物も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）により、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、Ｃｌ

ｅａｒｆｉｅｌｄ（登録商標）夏ナタネ（カノーラ）である。遺伝子操作方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ＲｏｕｎｄｕｐＲｅａｄｙ（登録商標）、Ｈｅｒｃｕｌｅｘ　Ｉ（登録商標）及びＬｉｂｅｒｔｙＬｉｎｋ（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。

【００７６】

「有用な植物」という用語は、特にバチルス属（Ｂａｃｉｌｌｕｓ）のものといった例えばトキシン産生バクテリア由来の公知であるものなどの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に、組換えＤＮＡ技術を用いて形質転換された有用な植物も含むと理解されるべきである。

【００７７】

このような植物の例は、ＹｉｅｌｄＧａｒｄ（登録商標）（ＣｒｙＩＡ（ｂ）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；ＹｉｅｌｄＧａｒｄ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）；ＹｉｅｌｄＧａｒｄ　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。

【００７８】

植物作物又はその種子材料は、両方とも除草剤に耐性であり、且つ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）に耐性であり得る。例えば、種子は、殺虫性Ｃｒｙ３タンパク質発現能を有する一方、同時にグリホサートに耐性であり得る。

【００７９】

作物植物は、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り、且ついわゆる出力形質（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）を含むものも含むと理解されるべきである。

【００８０】

式（Ｉ）の化合物（又はそれを含む組成物）は、望ましくない植物（総称して「雑草」）の防除に使用可能である。防除される雑草は、例えば、アグロスチス属（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。

【００８１】

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性組成物を提供するために配合物の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、任意に補助剤とを含む除草性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、農業での使用に好適なキャリアである。農業用キャリアは、当技術分野において周知である。

【００８２】

除草性組成物は、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％の製剤助剤とを含む。

【００８３】

組成物は、多数の配合物タイプから選択され得る。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になる。水溶剤（ＳＰ）は、水への分散性／溶解性を改善するために、式（Ｉ）の化合物を１種以上の水溶性無機塩（炭酸水素ナトリウム、炭酸ナトリウム又は硫酸マグネシウムなど）又は１種以上の水溶性有機固体（多糖など）及び任意に１種以上の湿潤剤、１種以上の分散剤又は前記物質の混合物と混合することによって調製され得る。次に、この混合物は、微粉末に粉砕される。また、同様の組成物を造粒して、水溶顆粒（ＳＧ）を形成し得る。水和剤（ＷＰ）は、式（Ｉ）の化合物を１種以上の固体希釈剤又は担体、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１種以上の懸濁化剤と混合して、液体中の分散を促進することによって調製され得る。次に、この混合物は、微粉末に粉砕される。また、同様の組成物を造粒して、水和性顆粒（ＷＧ）を形成し得る。粒剤（ＧＲ）は、式（Ｉ）の化合物と１種以上の粉末化された固体希釈剤又は担体との混合物を造粒することによるか、或いは式（Ｉ）の化合物（又は好適な物質中のその溶液）を多孔質の顆粒物質（軽石、アタパルジャイト粘土、フラー土、キーゼルグール、珪藻土又は粉砕されたトウモロコシの穂軸など）中に吸収することによるか、又は式（Ｉ）の化合物（又は好適な物質中のその溶液）を硬質のコア材（砂、ケイ酸塩、無機の炭酸塩、硫酸塩又はリン酸塩など）上に吸着し、必要に応じて乾燥させることにより、予め形成されたブランク顆粒から造粒することによるかのいずれかによって形成され得る。吸収又は吸着を補助するのに一般的に使用される物質としては、溶媒（脂肪族及び芳香族石油系溶媒、アルコール、エーテル、ケトン及びエステルなど）及び固着剤（ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、デキストリン、糖類及び植物油など）が挙げられる。また、１種以上の他の添加剤が粒剤に含まれ得る（例えば、乳化剤、湿潤剤又は分散剤）。分散性濃縮物（ＤＣ）は、式（Ｉ）の化合物を水又はケトン、アルコール若しくはグリコールエーテルなどの有機溶媒に溶解させることによって調製され得る。これらの溶液は、（例えば、水希釈性を改善するか、又は噴霧タンク中の結晶化を防止するために）表面活性剤を含有し得る。乳化性濃縮物（ＥＣ）又は水中油型乳剤（ＥＷ）は、式（Ｉ）の化合物を有機溶媒（１種以上の湿潤剤、１種以上の乳化剤又は前記物質

の混合物を任意に含有する）に溶解させることによって調製され得る。ＥＣに使用するのに適した有機溶媒としては、芳香族炭化水素（ＳＯＬＶＥＳＳＯ　１００、ＳＯＬＶＥＳＳＯ　１５０及びＳＯＬＶＥＳＳＯ　２００によって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；ＳＯＬＶＥＳＳＯは、登録商標である）、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）、脂肪酸のジメチルアミド（C_8～C_{10}脂肪酸の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製品は、水に加えると自然に乳化して、適切な装置によって噴霧施用可能なほど十分な安定性を有する乳剤を生成し得る。ＥＷの調製は、式（Ｉ）の化合物を液体として（それが室温で液体でない場合、適当な温度、典型的に７０℃未満で溶融させ得る）又は溶液中において（それを適切な溶媒に溶解させることによって）得る工程と、次に得られた液体又は溶液を高せん断下で１種以上のＳＡＡを含有する水に乳化して、乳剤を生成する工程とを含む。ＥＷに使用するのに適した溶媒としては、植物油、塩素化炭化水素（クロロベンゼンなど）、芳香族溶媒（アルキルベンゼン又はアルキルナフタレンなど）及び水溶性の低い他の適切な有機溶媒が挙げられる。マイクロエマルション（ＭＥ）は、水を１種以上のＳＡＡと１種以上の溶媒とのブレンドと混合して、熱力学的に安定した等方性液体製剤を自然に生じさせることによって調製され得る。式（Ｉ）の化合物は、最初、水又は溶媒／ＳＡＡブレンドのいずれかの中に存在する。ＭＥに使用するのに適した溶媒としては、ＥＣ又はＥＷへの使用に関して上述したものが挙げられる。ＭＥは、水中油型又は油中水型系のいずれかであり得（いずれの系が存在するかは、伝導度測定によって決定され得る）、水溶性及び油溶性有害生物防除剤を同じ製剤中で混合することに適し得る。ＭＥは、水に希釈するのに適しており、マイクロエマルションのまま残るか又は従来の水中油乳剤を形成する。懸濁液濃縮物（ＳＣ）は、式（Ｉ）の化合物の微粉化された不溶性固体粒子の水性又は非水性懸濁液を含み得る。ＳＣは、好適な媒体中において、式（Ｉ）の固体化合物を任意に１種以上の分散剤と共にボールミル粉砕又はビーズミル粉砕して、この化合物の微粒子懸濁液を生成することによって調製され得る。１種以上の湿潤剤が組成物に含まれ得、粒子の沈降速度を低下させるために懸濁化剤が含まれ得る。代わりに、式（Ｉ）の化合物は、乾式ミル粉砕され、上述した物質を含有する水に加えられて所望の最終生成物を生成し得る。エアゾール製剤は、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、好適な媒体（例えば、水又はｎ－プロパノールなどの水混和性液体）にも溶解又は分散されて、非加圧式の、手動噴霧ポンプにおいて使用するための組成物が得られる。カプセル懸濁剤（ＣＳ）は、各油滴がポリマーシェルによって封入され、且つ式（Ｉ）の化合物と、任意に、そのための担体又は希釈剤とを含有する油滴の水性分散液が得られる追加の重合段階を伴う以外は、ＥＷ製剤の調製と同様の方法で調製され得る。ポリマーシェルは、界面重縮合反応又はコアセルベーション手順のいずれかによって生成され得る。この組成物は、式（Ｉ）の化合物の制御放出を提供し、種子処理に使用され得る。式（Ｉ）の化合物は、生分解性ポリマーマトリックス中で製剤化されて、この化合物の遅延制御放出を提供することもできる。

【００８４】

組成物は、例えば、表面上の湿潤、保持又は分散；処理された表面における耐雨性；又は式（Ｉ）の化合物の取り込み又は移動性を改善することにより、組成物の生物学的性能を改善するために１種以上の添加剤を含み得る。このような添加剤は、表面活性剤（ＳＡＡ）、油性スプレー添加剤、例えば一定の鉱油又は天然植物油（大豆及びナタネ油など）、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補助剤（式（Ｉ）の化合物の作用を補助又は変性し得る処方成分）とのブレンドを含む。

【００８５】

湿潤剤、分散剤及び乳化剤は、カチオン型、アニオン型、両性型又は非イオン型のＳＡＡであり得る。好適なカチオン型のＳＡＡとしては、第四級アンモニウム化合物（例えば、臭化セチルトリメチルアンモニウム）、イミダゾリン及びアミン塩が挙げられる。好適

なアニオン型ＳＡＡとしては、脂肪酸のアルカリ金属塩、硫酸の脂肪族モノエステルの塩（例えば、ラウリル硫酸ナトリウム）、スルホン化された芳香族化合物の塩（例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム、スルホン酸ブチルナフタレン並びにジ－イソプロピル－及びトリ－イソプロピル－ナフタレンスルホン酸ナトリウムの混合物）、硫酸エーテル、硫酸アルコールエーテル（例えば、ラウレス－３－硫酸ナトリウム）、カルボン酸エーテル（例えば、ラウレス－３－カルボン酸ナトリウム）、リン酸エステル（１種以上の脂肪族アルコールとリン酸との反応からの生成物（主にモノ－エステル）又は五酸化リン（主にジ－エステル）、例えばラウリルアルコールとテトラリン酸との反応物；さらに、これらの生成物は、エトキシ化され得る）、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ネート、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ホスフェート／スルホネートが挙げられる。好適な両性型の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。好適な非イオン型のＳＡＡとしては、エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドなどのアルキレンオキシド又はそれらの混合物の、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）又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）との縮合生成物；長鎖脂肪酸又は無水ヘキシトールから誘導される部分エステル；前記部分エステルのエチレンオキシドとの縮合生成物；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；単純なエステル（例えば、脂肪酸ポリエチレングリコールエステル）；アミンオキシド（例えば、ラウリルジメチルアミンオキシド）；レシチン及びソルビタン並びにそのエステル、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。

【００８６】

好適な懸濁化剤としては、親水コロイド（多糖類、ポリビニルピロリドン又はカルボキシメチルセルロースナトリウムなど）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。

【００８７】

本発明を含有する化合物はまた、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で使用可能である。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（ベンスルフロン－メチルを含む）、ベンタゾン、ビシクロピロン、ビラナホス、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、ブロモキシニル、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、クロルスルフロン、シンメチリン、クラシホス、クレトジム、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、シクロスルファムロン、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、デスメディファム、ジカンバ（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、その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、ダイコートジブロミド、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）、フェノキサスルフォン、フェンピラゾン、フェンキノトリオン、フェントラザミド、フラザスルフロン、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ン（フルピルスルフロン－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、ホラムスルフロン、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、イオドスルフロン（イオドスルフロン－メチル－ナトリウムを含む）、イオフェンスルフロン（イオフェンスルフロン－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、メソスルフロン（メソスルフロン－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、メトスルフロン、ナプロパミド、ニコスルフロン、ノルフラゾン、オキサジアゾン、オキサスルフロン、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、フェンメディファム、ピクロラム、ピノキサデン、プレチラクロール、プリミスルフロン－メチル、プロメトリン、プロパニル、プロパキザホップ、プロピリスルフロン、プロピザミド、プロスルホカルブ、プロスルフロン、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、ピリミスルファン、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、キザロホップ（キザロホップ－Ｐ－エチル及びキザロホップ－Ｐ－テフリルを含む）、リミソキサフェン、リムスルフロン、サフルフェナシル、セトキシジム、シマジン、Ｓ－メタロクロール、スルフェントラゾン、スルホスルフロン、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、チフェンスルフロン、チアフェナシル、トルピラレート、トプラメゾン、トラルコキシジム、トリアファモネ、トリアレート、トリアスルフロン、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ン（トリフロキシスルフロン－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、トリフルスルフロン、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－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）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－カルボキシレートを含む）、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］トリアゾロ［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－［（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－［（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－［（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。式（Ｉ）の化合物の混合相手は、例えば、Ｔｈｅ　Ｐｅｓｔｉｃｉｄｅ　Ｍａｎｕａｌ，Ｓｉｘｔｅｅｎｔｈ　Ｅｄｉｔｉｏｎ，Ｂｒｉｔｉｓｈ　Ｃｒｏｐ　Ｐｒｏｔｅｃｔｉｏｎ　Ｃｏｕｎｃｉｌ，２０１２に記載されているとおり、エステル又は塩の形態でもあり得る。式（Ｉ）の化合物対混合相手の混合比は、１：１００～１０００：１であることが好ましい。

【００８８】

混合物は、上記の配合物において有利に使用可能である（この事例において、「有効成分」は、式（Ｉ）の化合物と混合相手との対応する混合物に関連する）。

【００８９】

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用いることもできる。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－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－エチルを含む）、メフェンピル（メフェンピル－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）の化合物の毒性緩和剤は、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もあり得る。クロキントセットメキシルに対する言及は、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。

【００９０】

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。

【００９１】

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あって、必要に応じて配合物の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混合物でもあり得る。

【００９２】

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、又は種子が土壌に蒔かれることになる圃場を意味する。これは、土壌、種子及び実生並びに確立した植生を含む。

【００９３】

「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。

【００９４】

「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。発芽後若しくは土壌から出芽した後に移植されることに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。

【００９５】

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

【００９６】

式（Ｉ）の化合物は、そのままの形態において又は好ましくは配合技術分野において簡便に採用される補助剤と一緒に用いられ得る。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適用方法は、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。

【００９７】

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。

【００９８】

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、軟体動物駆除剤でもあり得るか、又はこれらの調製物の数種の混合物であって、必要に応じて配合物の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混合物でもあり得る。

【００９９】

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、有害生物防除剤、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。

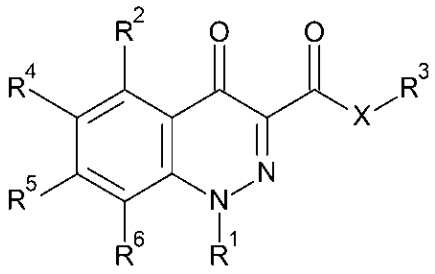
【０１００】

通常、配合物は、０．０１～９０重量％の活性薬剤、０～２０％の農学的に許容される界面活性剤並びに１０～９９．９９％の固体又は液体不活性配合物及び補助剤を含み、活性薬剤は、コンポーネント（Ｂ）及び（Ｃ）並びに任意に他の活性薬剤、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％の活性薬剤を含有する。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％の活性薬剤を含有し得る。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になる。

【０１０１】

以下の表は、本発明に係る個別の式（Ｉ）の化合物

【化１４】



(I)

を例示する。

【０１０２】

【表１－１】

表 1: 本発明に係る個別の式(I)の化合物

No.	R^1	R^2	R^3
001	6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Et
002	6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Me
003	6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	H
004	6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル	1-エトキシビニル	Et
005	6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル	1-エトキシビニル	Me
006	6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル	1-エトキシビニル	H
007	6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル	1-メトキシビニル	Et
008	6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル	1-メトキシビニル	Me
009	6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル	1-メトキシビニル	H
010	6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル	アセチル	Et
011	6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル	アセチル	Et
012	6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル	アセチル	Me
013	6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル	アセチル	H
014	6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル	メチルスルホニル	Et
015	6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル	メチルスルホニル	Me
016	6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル	メチルスルホニル	H
017	6-(トリフルオロメトキシ)-3-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Et
018	6-(トリフルオロメトキシ)-3-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Me
019	6-(トリフルオロメトキシ)-3-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	H
020	6-(トリフルオロメトキシ)-3-ピリジル	1-エトキシビニル	Et
021	6-(トリフルオロメトキシ)-3-ピリジル	1-エトキシビニル	Me
022	6-(トリフルオロメトキシ)-3-ピリジル	1-エトキシビニル	H
023	6-(トリフルオロメトキシ)-3-ピリジル	1-メトキシビニル	Et
024	6-(トリフルオロメトキシ)-3-ピリジル	1-メトキシビニル	Me
025	6-(トリフルオロメトキシ)-3-ピリジル	1-メトキシビニル	H
026	6-(トリフルオロメトキシ)-3-ピリジル	アセチル	Et
027	6-(トリフルオロメトキシ)-3-ピリジル	アセチル	Me
028	6-(トリフルオロメトキシ)-3-ピリジル	アセチル	H
029	6-(トリフルオロメトキシ)-3-ピリジル	メチルスルホニル	Et
030	6-(トリフルオロメトキシ)-3-ピリジル	メチルスルホニル	Me
031	6-(ジフルオロメチル)-3-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Et
032	6-(ジフルオロメチル)-3-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Me
033	6-(ジフルオロメチル)-3-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	H
034	6-(ジフルオロメチル)-3-ピリジル	1-エトキシビニル	Et

【表１－２】

035	6-(ジフルオロメチル)-3-ピリジル	1-エトキシビニル	Me
036	6-(ジフルオロメチル)-3-ピリジル	1-エトキシビニル	H
037	6-(ジフルオロメチル)-3-ピリジル	1-メトキシビニル	Et
038	6-(ジフルオロメチル)-3-ピリジル	1-メトキシビニル	Me
039	6-(ジフルオロメチル)-3-ピリジル	1-メトキシビニル	H
040	6-(ジフルオロメチル)-3-ピリジル	アセチル	Et
041	6-(ジフルオロメチル)-3-ピリジル	アセチル	Me
042	6-(ジフルオロメチル)-3-ピリジル	アセチル	H
043	6-(ジフルオロメチル)-3-ピリジル	メチルスルホニル	Et
044	6-(ジフルオロメチル)-3-ピリジル	メチルスルホニル	Me
045	6-(ジフルオロメチル)-3-ピリジル	メチルスルホニル	H
046	6-メトキシ-3-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Et
047	6-メトキシ-3-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Me
048	6-メトキシ-3-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	H
049	6-メトキシ-3-ピリジル	1-エトキシビニル	Et
050	6-メトキシ-3-ピリジル	1-エトキシビニル	Me
051	6-メトキシ-3-ピリジル	1-エトキシビニル	H
052	6-メトキシ-3-ピリジル	1-メトキシビニル	Et
053	6-メトキシ-3-ピリジル	1-メトキシビニル	Me
054	6-メトキシ-3-ピリジル	1-メトキシビニル	H
055	6-メトキシ-3-ピリジル	アセチル	Et
056	6-メトキシ-3-ピリジル	アセチル	Me
057	6-メトキシ-3-ピリジル	アセチル	H
058	6-メトキシ-3-ピリジル	メチルスルホニル	Et
059	6-メトキシ-3-ピリジル	メチルスルホニル	Me
060	6-メトキシ-3-ピリジル	メチルスルホニル	H
061	6-クロロ-3-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Et
062	6-クロロ-3-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Me
063	6-クロロ-3-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	H
064	6-クロロ-3-ピリジル	1-エトキシビニル	Et
065	6-クロロ-3-ピリジル	1-エトキシビニル	Me
066	6-クロロ-3-ピリジル	1-エトキシビニル	H
067	6-クロロ-3-ピリジル	1-メトキシビニル	Et
068	6-クロロ-3-ピリジル	1-メトキシビニル	Me
069	6-クロロ-3-ピリジル	1-メトキシビニル	H
070	6-クロロ-3-ピリジル	アセチル	Et
071	6-クロロ-3-ピリジル	アセチル	Me
072	6-クロロ-3-ピリジル	アセチル	H
073	6-クロロ-3-ピリジル	メチルスルホニル	Et
074	6-クロロ-3-ピリジル	メチルスルホニル	Me
075	6-クロロ-3-ピリジル	メチルスルホニル	H

【表１－３】

076	6-フルオロ-3-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Et
077	6-フルオロ-3-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Me
078	6-フルオロ-3-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	H
079	6-フルオロ-3-ピリジル	1-エトキシビニル	Et
080	6-フルオロ-3-ピリジル	1-エトキシビニル	Me
081	6-フルオロ-3-ピリジル	1-エトキシビニル	H
082	6-フルオロ-3-ピリジル	1-メトキシビニル	Et
083	6-フルオロ-3-ピリジル	1-メトキシビニル	Me
084	6-フルオロ-3-ピリジル	1-メトキシビニル	H
085	6-フルオロ-3-ピリジル	アセチル	Et
086	6-フルオロ-3-ピリジル	アセチル	Me
087	6-フルオロ-3-ピリジル	アセチル	H
088	6-フルオロ-3-ピリジル	メチルスルホニル	Et
089	6-フルオロ-3-ピリジル	メチルスルホニル	Me
090	6-フルオロ-3-ピリジル	メチルスルホニル	H
091	5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Et
092	5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Me
093	5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	H
094	5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル	1-エトキシビニル	Et
095	5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル	1-エトキシビニル	Me
096	5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル	1-エトキシビニル	H
097	5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル	1-メトキシビニル	Et
098	5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル	1-メトキシビニル	Me
099	5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル	1-メトキシビニル	H
100	5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル	アセチル	Et
101	5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル	アセチル	Me
102	5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル	アセチル	H
103	5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル	メチルスルホニル	Et
104	5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル	メチルスルホニル	Me
105	5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル	メチルスルホニル	H
106	5-クロロ-2-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Et
107	5-クロロ-2-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Me
108	5-クロロ-2-ピリジル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	H
109	5-クロロ-2-ピリジル	1-エトキシビニル	Et
110	5-クロロ-2-ピリジル	1-エトキシビニル	Me
111	5-クロロ-2-ピリジル	1-エトキシビニル	H
112	5-クロロ-2-ピリジル	1-メトキシビニル	Et
113	5-クロロ-2-ピリジル	1-メトキシビニル	Me

【表１－４】

114	5-クロロ-2-ピリジル	1-メトキシビニル	H
115	5-クロロ-2-ピリジル	アセチル	Et
116	5-クロロ-2-ピリジル	アセチル	Me
117	5-クロロ-2-ピリジル	アセチル	H
118	5-クロロ-2-ピリジル	メチルスルホニル	Et
119	5-クロロ-2-ピリジル	メチルスルホニル	Me
120	5-クロロ-2-ピリジル	メチルスルホニル	H
121	5-(トリフルオロメチル)-3-チエニル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Et
122	5-(トリフルオロメチル)-3-チエニル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Me
123	5-(トリフルオロメチル)-3-チエニル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	H
124	5-(トリフルオロメチル)-3-チエニル	1-エトキシビニル	Et
125	5-(トリフルオロメチル)-3-チエニル	1-エトキシビニル	Me
126	5-(トリフルオロメチル)-3-チエニル	1-エトキシビニル	H
127	5-(トリフルオロメチル)-3-チエニル	1-メトキシビニル	Et
128	5-(トリフルオロメチル)-3-チエニル	1-メトキシビニル	Me
129	5-(トリフルオロメチル)-3-チエニル	1-メトキシビニル	H
130	5-(トリフルオロメチル)-3-チエニル	アセチル	Et
131	5-(トリフルオロメチル)-3-チエニル	アセチル	Me
132	5-(トリフルオロメチル)-3-チエニル	アセチル	H
133	5-(トリフルオロメチル)-3-チエニル	メチルスルホニル	Et
134	5-(トリフルオロメチル)-3-チエニル	メチルスルホニル	Me
135	5-(トリフルオロメチル)-3-チエニル	メチルスルホニル	H
136	1-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-イル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Et
137	1-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-イル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	Me
138	1-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-イル	N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル	H
139	1-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-イル	1-エトキシビニル	Et
140	1-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-イル	1-エトキシビニル	Me
141	1-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-イル	1-エトキシビニル	H
142	1-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-イル	1-メトキシビニル	Et
143	1-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-イル	1-メトキシビニル	Me
144	1-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-イル	1-メトキシビニル	H
145	1-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-イル	アセチル	Et
146	1-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-イル	アセチル	Me

【表１－５】

147	1-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-イル	アセチル	H
148	1-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-イル	メチルスルホニル	Et
149	1-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-イル	メチルスルホニル	Me
150	1-メチル-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-イル	メチルスルホニル	H

【０１０３】
表Ａ－１は、１５０種の式（Ｉ）の化合物Ａ－１．００１～Ａ．１．１５０を提供し、ここで、Ｘは酸素であり、R^4、R^5及びR^6は水素であり、並びに、R^1、R^2及びR^3は表１に定義されているとおりである。
【０１０４】
配合例
【０１０５】
【表２】

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 %
ナトリウムジイソブチルナフタレンスルホネート	–	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 %	–

【０１０６】
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することで水和剤が得られ、これを水で希釈して、所望の濃度の懸濁液を得ることが可能である。
【０１０７】
【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 %
軽油	5 %	5 %	5 %
高分散ケイ酸	5 %	5 %	–
カオリン	65 %	40 %	–
タルカム	–		20 %

【０１０８】
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することで、種子処理に直接用いることが可能である粉末が得られる。
【０１０９】
乳化性濃縮物
有効成分［式（Ｉ）の化合物］　１０％

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％
（４～５ｍｏｌ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（３５ｍｏｌ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％
【０１１０】
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。
【０１１１】
【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％

【０１１２】
直ち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砕することにより得られる。このような粉末は、種子の乾燥粉衣にも用いられ得る。
【０１１３】
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％
【０１１４】
有効成分を混合し、補助剤と共に粉砕し、この混合物を水で加湿する。混合物を押し出し、次いで空気流中で乾燥させる。
【０１１５】
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％
【０１１６】
細かく粉砕した有効成分を、ポリエチレングリコールで加湿し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。
【０１１７】
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（１５ｍｏｌ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％
水　３２％
【０１１８】

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で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。

【０１１９】

種子処理用の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％

コポリマーブタノールＰＯ／ＥＯ　２％

トリスチレンフェノール＋１０～２０モルＥＯ　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％

シリコーン油（７５％水中エマルジョンの形態）　０．２％

水　４５．３％

【０１２０】

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で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。

【０１２１】

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おいて、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２．８部の１，６－ジアミノヘキサンの５．３部の水中の混合物を添加する。この混合物を重合反応が完了するまで撹拌する。得られたカプセル懸濁液を、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ものである。中間カプセル直径は、８～１５ミクロンである。この目的に好適な装置中において、得られる配合物を水性懸濁液として種子に適用する。

【実施例】

【０１２２】

以下の非限定的な例は、以下の表２において言及されている本発明の代表的な化合物の特定の合成方法を提供する。

【０１２３】

略語リスト

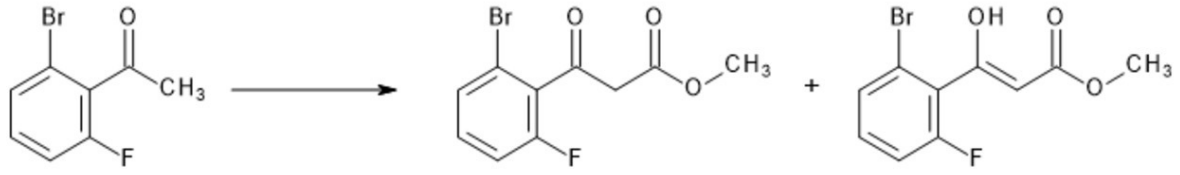
℃＝摂氏度、Å＝オングストローム、ＣＤＣｌ$_3$＝クロロホルム－ｄ、ｄ＝二重項、ｄｄ＝二重項の二重項、ＤＭＳＯ＝ジメチルスルホキシド、ｍ＝多重項、Ｍ＝モル数、ＭＨｚ＝メガヘルツ、ｑ＝四重項、ｓ＝一重項、ｔ＝三重項

【０１２４】

実施例１：５－シアノ－４－オキソ－１－ピリミジン－５－イル－シノリン－３－カルボン酸（化合物１）の合成

ステップ１：メチル３－（２－ブロモ－６－フルオロ－フェニル）－３－オキソ－プロパノエートの合成

【化１５】

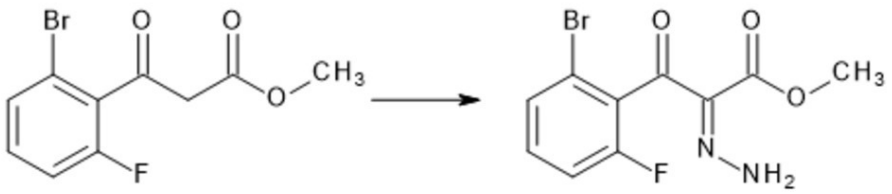


窒素雰囲気下において、０℃に冷却した１－（２－ブロモ－６－フルオロ－フェニル）エタノン（５．０ｇ、２３．０ｍｍｏｌ）及びジメチルカーボネート（３７．３ｇ、４０６ｍｍｏｌ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（２０ｍＬ）中の撹拌溶液に水素化ナトリウム（２．８ｇ、６９．１ｍｍｏｌ、６０質量％）を数回に分けて添加した。この反応を室温に温め、２４時間撹拌した。反応混合物を氷上にゆっくりと注ぎかけ、濃塩酸でｐＨ３に酸性化した。相を分離し、水性相をジエチルエーテルで再抽出した。組み合わせた有機抽出物を硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、シクロヘキサン中の０～３０％の酢酸エチルの勾配を溶離液として用いるシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、所望の生成物（互変異性体の混合物）を無色の液体として得た。ケト形態：^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）δ＝７．４６－７．３６（ｍ，１Ｈ），７．３３－７．２８（ｍ，１Ｈ），７．１５－６．９８（ｍ，１Ｈ），３．９８－３．９０（ｍ，２Ｈ），３．７９－３．６１（ｍ，３Ｈ）

【０１２５】

ステップ２：メチル（２Ｚ）－３－（２－ブロモ－６－フルオロ－フェニル）－２－ヒドラジニリデン－３－オキソ－プロパノエートの合成

【化１６】

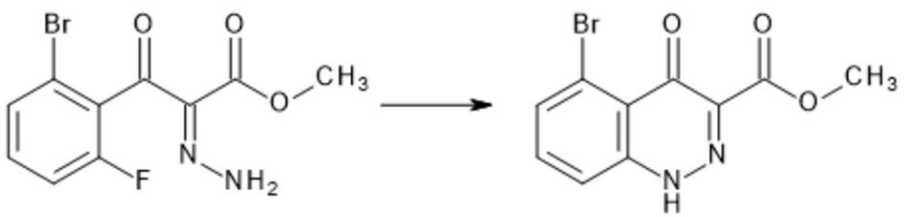


メチル３－（２－ブロモ－６－フルオロ－フェニル）－３－オキソ－プロパノエート（１．００ｇ、３．２７ｍｍｏｌ）のアセトニトリル（１０ｍＬ）中の冷却した（０℃）溶液に、窒素雰囲気下で、トリエチルアミン（２．３０ｍＬ、１６．４ｍｍｏｌ）を添加し、続いて、４－アセトアミドベンゼンスルホニルアジド（０．７８５ｇ、３．２７ｍｍｏｌ）のアセトニトリル（５ｍＬ）中の溶液を滴下した。反応混合物を氷浴中において１５分間撹拌し、次いで、室温で２時間撹拌した。この時間の後、得られた反応混合物を０℃に冷却し、トリブチルホスフィン（０．８２６ｍＬ、３．２７ｍｍｏｌ）を滴下した。反応混合物を２時間撹拌した。反応混合物を水及び酢酸エチル（５０ｍＬ）中に分割した。相を分離し、水性相を酢酸エチル（２×５０ｍＬ）中に抽出した。組み合わせた有機抽出物を塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、溶離液としてヘキサン中に０～３０％酢酸エチルの勾配を用いるシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、所望の生成物を明るい茶色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ＝１０．８（ｓ，１Ｈ），１０．６（ｓ，１Ｈ），７．４７（ｄ，１Ｈ），７．３８－７．２６（ｍ，２Ｈ），３．８０（ｓ，３Ｈ）．

【０１２６】

ステップ３：メチル５－ブロモ－４－オキソ－１Ｈ－シノリン－３－カルボキシレートの合成

【化１７】



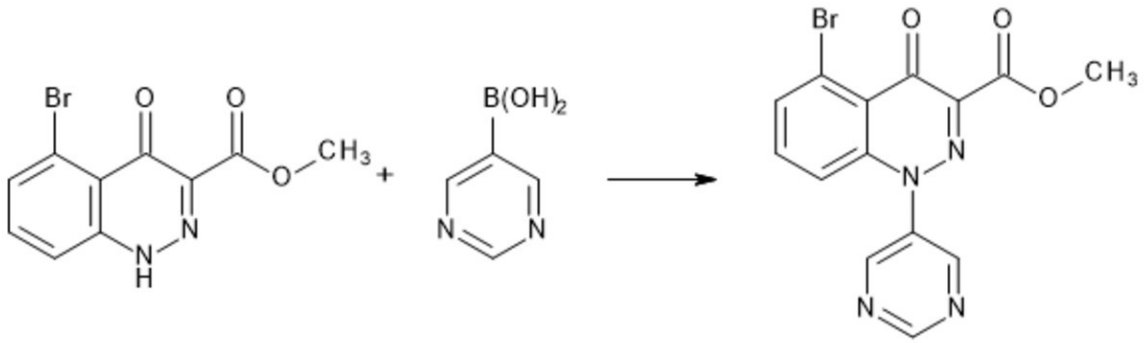
メチル（２Ｚ）－３－（２－ブロモ－６－フルオロ－フェニル）－２－ヒドラジニリデ

ン－３－オキソ－プロパノエート（０．７００ｇ、２．１９ｍｍｏｌ）のジグリム（１．５ｍＬ）中の溶液を１５０℃で４時間加熱した。この時間の後、メチルｔｅｒｔ－ブチルエーテル（２０ｍＬ）を添加して反応混合物を冷却し、混合物を２０分間撹拌した。得られた沈殿物をろ過し、固体を空気乾燥させて、メチル５－ブロモ－４－オキソ－１Ｈ－シノリン－３－カルボキシレートを茶色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ＝１３．８（ｓ，１Ｈ），７．７１－７．６４（ｍ，３Ｈ），３．８３（ｓ，３Ｈ）．

【０１２７】

ステップ４：メチル５－ブロモ－４－オキソ－１－ピリミジン－５－イル－シノリン－３－カルボキシレートの合成

【化１８】

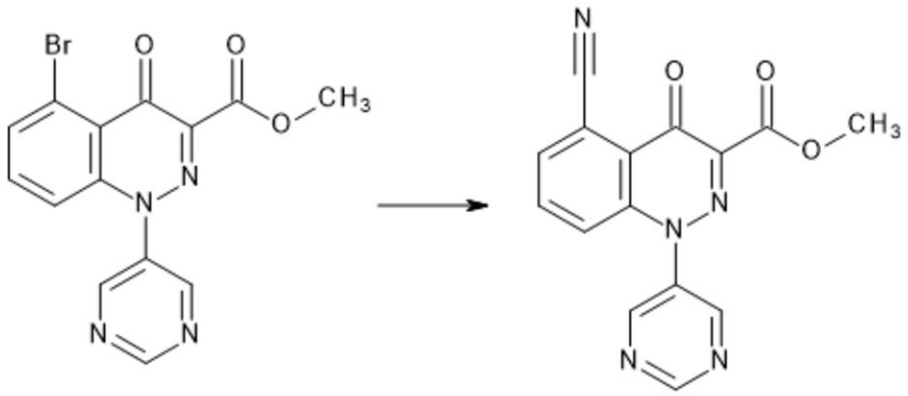


メチル５－ブロモ－４－オキソ－１Ｈ－シノリン－３－カルボキシレート（０．７００ｇ、２．４７ｍｍｏｌ）のアセトニトリル（３０ｍＬ）中の混合物に、トリエチルアミン（１．４３ｍＬ、９．８９ｍｍｏｌ）、酢酸銅（ＩＩ）（０．４９４ｇ、２．７２ｍｍｏｌ）及びピリミジン－５－イルボロン酸（０．６１３ｇ、４．９５ｍｍｏｌ）を添加した。得られた溶液を６５℃で１６時間加熱した。反応混合物を珪藻土でろ過し、水及びジクロロメタン中に分割した。水性相をジクロロメタン（２回）中に抽出し、組み合わせた有機抽出物を水及び塩水で順次に洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、溶離液としてヘキサン中に０～５０％酢酸エチルの勾配を用いるシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、所望の生成物を茶色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ＝７．８３（ｄ，１Ｈ），７．７１－７．６９（ｍ，１Ｈ），７．６２－７．６１（ｍ，２Ｈ），７．５９（ｔ，１Ｈ），７．３２（ｄ，１Ｈ），３．８３（ｓ，３Ｈ）．

【０１２８】

ステップ５：メチル５－シアノ－４－オキソ－１－ピリミジン－５－イル－シノリン－３－カルボキシレートの合成

【化１９】



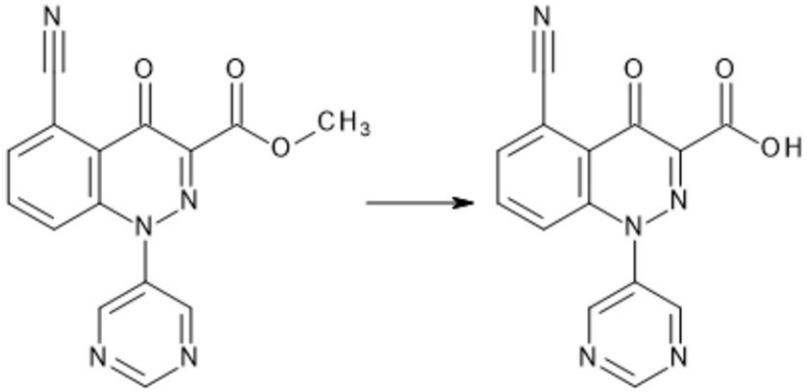
メチル５－ブロモ－４－オキソ－１－ピリミジン－５－イル－シノリン－３－カルボキ

シレート（０．１４０ｇ、０．３３０ｍｍｏｌ）、ジシアノ亜鉛（０．０７７ｇ、０．６５９ｍｍｏｌ）及びテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０．０３８ｇ、０．０３３ｍｍｏｌ）のジメチルホルムアミド（５ｍＬ）中の混合物を、アルゴンでパージし、その後、マイクロ波の照射下に１６０℃で１時間加熱した。反応混合物を珪藻土でろ過し、減圧下で乾燥するまで濃縮した。粗残渣を、溶離液としてシクロヘキサン中に０～１００％の酢酸エチルの勾配を用いるシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、所望の生成物を茶色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ＝９．４６（ｓ，１Ｈ），９．２０（ｓ，２Ｈ），８．１４（ｄ，１Ｈ），７．９１（ｔ，１Ｈ），７．７２（ｄ，１Ｈ），３．８７（ｓ，３Ｈ）．

【０１２９】

ステップ６：５－シアノ－４－オキソ－１－ピリミジン－５－イル－シノリン－３－カルボン酸（化合物１）の合成

【化２０】

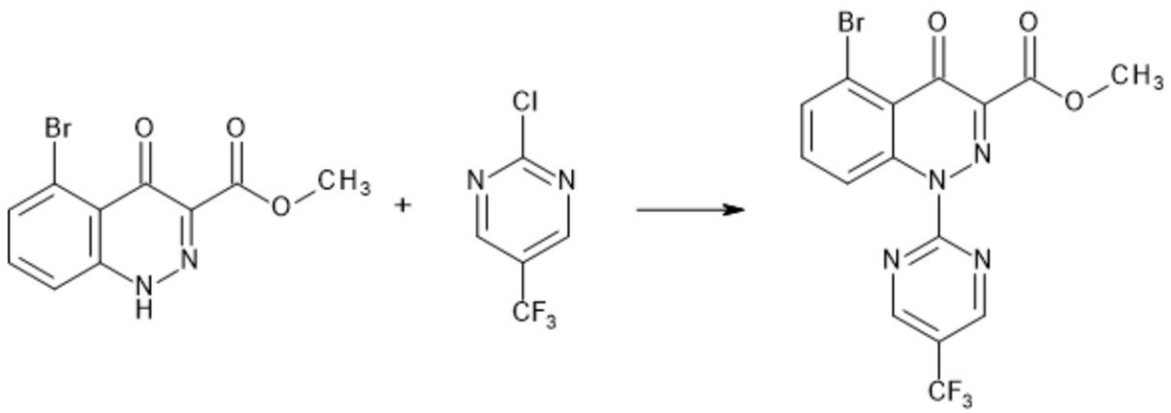


メチル５－シアノ－４－オキソ－１－ピリミジン－５－イル－シノリン－３－カルボキシレート（０．０８８ｇ、０．２００ｍｍｏｌ）のテトラヒドロフラン（５ｍＬ）中の溶液に、水酸化リチウム一水和物（０．００７３ｇ、０．１７ｍｍｏｌ）の水（１ｍＬ）中の溶液を添加した。得られた溶液を周囲温度で１時間撹拌した。溶剤を減圧下で除去し、残渣を水（２０ｍＬ）で希釈した。得られた水性混合物のｐＨを濃塩酸の添加によりｐＨ２に調節した。析出した固体をろ過により集め、減圧下で乾燥させて所望の生成物を明るい茶色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ＝９．４６（ｓ，１Ｈ），９．２０（ｓ，２Ｈ），８．１３（ｄ，１Ｈ），７．９１（ｔ，１Ｈ），７．４３（ｄ，１Ｈ）．

【０１３０】

実施例２：メチル５－ブロモ－４－オキソ－１－［５－（トリフルオロメチル）ピリミジン－２－イル］シノリン－３－カルボキシレート（化合物２）の合成

【化２１】



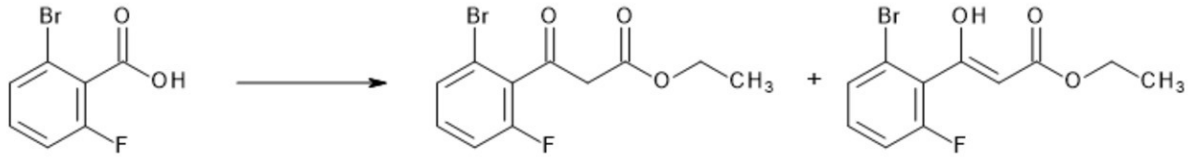
メチル５－ブロモ－４－オキソ－１Ｈ－シノリン－３－カルボキシレート（０．５００ｇ、１．７７ｍｍｏｌ）のジメチルホルムアミド（５ｍＬ）中の溶液に、２－クロロ－５－（トリフルオロメチル）ピリミジン（０．６４５ｇ、３．５３ｍｍｏｌ）及び炭酸カリウム（０．７３１ｇ、５．３０ｍｍｏｌ）を添加した。反応混合物をマイクロ波の照射下に１２０℃で１時間加熱した。反応混合物を珪藻土でろ過し、次いで、水（５０ｍＬ）及びジクロロメタン（５０ｍＬ）中に分割した。相を分離し、水性相をジクロロメタン（２×５０ｍＬ）中に抽出した。組み合わせた有機抽出物を水及び塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、溶離液としてヘキサン中に０～５０％酢酸エチルの勾配を用いるシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、所望の生成物を明るい黄色の固体として得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ＝９．５７（ｓ，２Ｈ），７．８８－７．８５（ｍ，２Ｈ），７．６３（ｔ，１Ｈ），３．８７（ｓ，３Ｈ）．

【０１３１】

実施例３：エチル５－ブロモ－１－（２－クロロ－４－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物３）の合成

ステップ１：エチル３－（２－ブロモ－６－フルオロ－フェニル）－３－オキソ－プロパノエートの合成

【化２２】

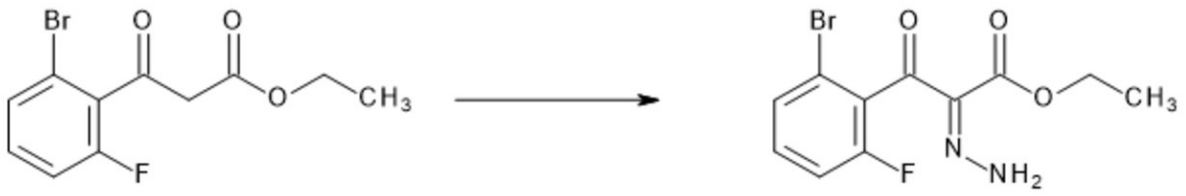


２－ブロモ－６－フルオロ－安息香酸（０．５００ｇ、２．３ｍｍｏｌ）をテトラヒドロフラン（４．６ｍＬ）中に溶解し、氷浴で冷却しながら、窒素雰囲気下で撹拌した。ジ（イミダゾール－１－イル）メタノン（０．４８ｇ、３．０ｍｍｏｌ）を添加し、反応混合物を６５℃で０．５時間加熱した。一方で、カリウム；３－エトキシ－３－オキソ－プロパン酸（１．３０ｇ、７．６ｍｍｏｌ）及び塩化マグネシウム（０．３７ｇ、３．９ｍｍｏｌ）をテトラヒドロフラン（６．９ｍＬ）に添加し、懸濁液として室温で撹拌した。トリエチルアミン（０．７７ｇ、７．６ｍｍｏｌ）を添加し、反応混合物を６５℃で３時間加熱し、その後、上記のとおり調製した溶液を滴下した。添加が完了したら、反応混合物を５０℃で１８時間加熱した。冷却した反応混合物を塩化水素水溶液（２Ｍ）及び酢酸エチル中に分割した。有機相を塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、溶離液としてシクロヘキサン中に０～１００％の酢酸エチルの勾配を用いるシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、所望の生成物（互変異性体の混合物）を得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝１２．２９（ｓ，１Ｈ）エノール、７．４５～７．３９（ｍ，１Ｈ）、７．３２～７．２３（ｍ，１Ｈ）、７．１４～７．０７（ｍ，１Ｈ）、５．２８（ｓ，１Ｈ）エノール、４．２９（ｑ，１Ｈ）エノール、４．１９（ｑ，１Ｈ）ケト、３．９１（ｄ，１Ｈ）ケト、１．３４（ｔ，１Ｈ）エノール、１．２４（ｔ，２Ｈ）ケト。

【０１３２】

ステップ２：エチル（２Ｚ）－３－（２－ブロモ－６－フルオロ－フェニル）－２－ヒドラジニリデン－３－オキソ－プロパノエートの合成

【化２３】

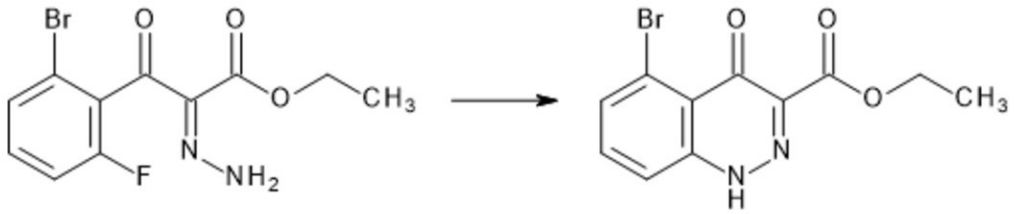


メチル５－ブロモ－４－オキソ－１Ｈ－シノリン－３－カルボキシレートと同様に、エチル３－（２－ブロモ－６－フルオロ－フェニル）－３－オキソ－プロパノエート（１．０ｇ、３．５ｍｍｏｌ）から調製を行って、エチル（２Ｚ）－３－（２－ブロモ－６－フルオロ－フェニル）－２－ヒドラジニリデン－３－オキソ－プロパノエートを得た。^{1}ＨＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ　ｐｐｍ　７．３４（ｄ，１Ｈ），７．２０（ｔｄ，１Ｈ），７．０３（ｔ，１Ｈ），４．３９（ｑ，２Ｈ），１．４０（ｔ，３Ｈ）．

【０１３３】

ステップ３：エチル５－ブロモ－４－オキソ－１Ｈ－シノリン－３－カルボキシレートの合成

【化２４】

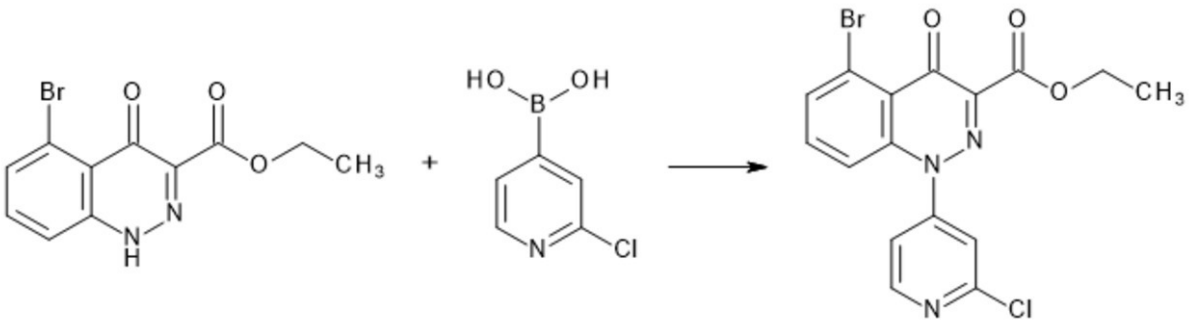


メチル５－ブロモ－４－オキソ－１Ｈ－シノリン－３－カルボキシレートと同様に、エチル（２Ｚ）－３－（２－ブロモ－６－フルオロ－フェニル）－２－ヒドラジニリデン－３－オキソ－プロパノエート（２．１ｇ、６．６ｍｍｏｌ）をビス（２－メトキシエチル）エーテル（１．５ｍＬ）中において１５０℃で用いて調製を行って、エチル５－ブロモ－４－オキソ－１Ｈ－シノリン－３－カルボキシレートを得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ　ｐｐｍ　７．７７（ｄ，１Ｈ），７．６７（ｄ，１Ｈ），７．５６－７．４９（ｍ，１Ｈ），４．５２（ｑ，２Ｈ），１．４４（ｔ，３Ｈ）．

【０１３４】

ステップ４：エチル５－ブロモ－４－オキソ－１Ｈ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物３）の合成

【化２５】



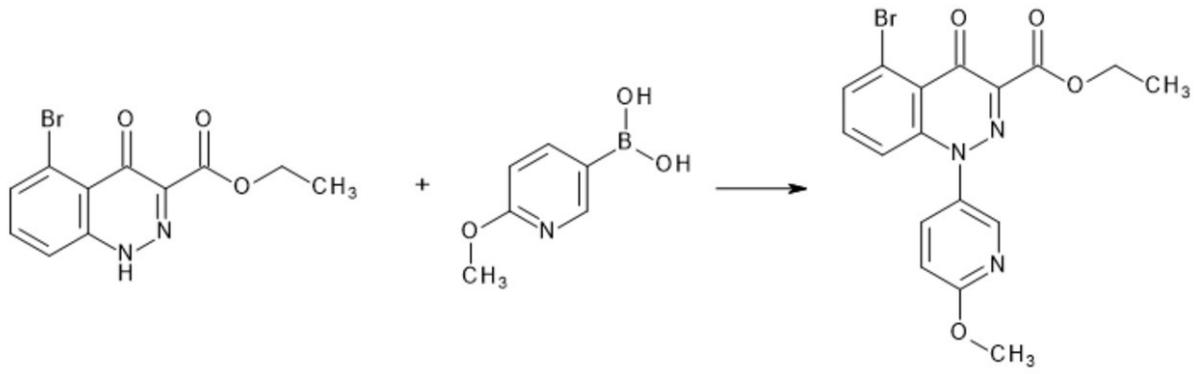
アセトニトリル（２０ｍＬ）中のエチル５－ブロモ－４－オキソ－１Ｈ－シノリン－３－カルボキシレート（０．５００ｇ、１．７ｍｍｏｌ）に、（２－クロロ－４－ピリジル）ボロン酸（０．５５ｇ、３．５ｍｍｏｌ）及び酢酸銅（ＩＩ）（０．３６ｇ、２．０ｍｍｏｌ）を添加した。反応混合物を５０℃で６時間加熱した。冷却した反応混合物を塩化

水素水溶液（２Ｍ）に注ぎ入れ、ジクロロメタン中に抽出した。有機抽出物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、次いで、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、溶離液として水（＋０．１％ギ酸）中に２０～８５％のアセトニトリル（＋０．１％ギ酸）の勾配を用いる逆相Ｃ－１８シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、所望の生成物を薄い黄色の液体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ　ｐｐｍ＝８．６５（ｄ，１Ｈ），７．７６（ｄｄ，１Ｈ），７．５７（ｄ，１Ｈ），７．５０－７．４１（ｍ，２Ｈ），７．２８（ｄｄ，１Ｈ），４．４６（ｑ，２Ｈ），１．４２（ｔ，３Ｈ）．

【０１３５】

実施例４：エチル５－ブロモ－１－（６－メトキシ－３－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物４）の合成

【化２６】



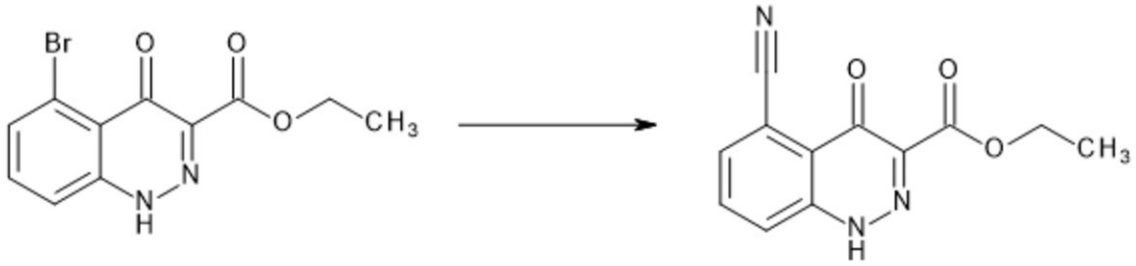
エチル５－ブロモ－４－オキソ－１Ｈ－シノリン－３－カルボキシレート（０．７５０ｇ、２．５２ｍｍｏｌ）のアセトニトリル（５０ｍＬ）中の懸濁液に、酢酸銅（ＩＩ）一水和物（０．５５５ｇ、１．７８ｍｍｏｌ）、Ｎ，Ｎ－ジエチルエタンアミン（１．０２ｇ、１０．１ｍｍｏｌ）及び４Å分子ふるい（０．０６１ｇ）を添加した。圧縮空気を反応混合物に通気させ、続いて、６－メトキシ－３－ピリジル）ボロン酸（０．８１１ｇ、５．３０ｍｍｏｌ）を、室温で数回に分けて添加した。反応混合物を、６０℃で０．５時間、圧縮空気流下で加熱し、次いで、６０℃で１８時間加熱した。冷却した反応混合物を塩化水素水溶液（２Ｍ）に注ぎ入れ、酢酸エチル（３回）中に抽出した。組み合わせた有機抽出物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、次いで、塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、溶離液として水（＋０．１％ギ酸）中に４０～７０％のアセトニトリル（＋０．１％ギ酸）の勾配を用いる逆相Ｃ－１８シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、所望の生成物を茶色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝８．３１（ｄ，１Ｈ），７．７２－７．６６（ｍ，２Ｈ），７．３９（ｄｄ，１Ｈ），７．１１（ｄｄ，１Ｈ），６．９６（ｄ，１Ｈ），４．４４（ｑ，２Ｈ），４．０２（ｓ，３Ｈ），１．４０（ｔ，３Ｈ）．

【０１３６】

実施例５：エチル５－シアノ－１－（６－メトキシ－５－メチル－３－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物１６）の合成

ステップ１：エチル５－シアノ－４－オキソ－１Ｈ－シノリン－３－カルボキシレートの合成

【化２７】

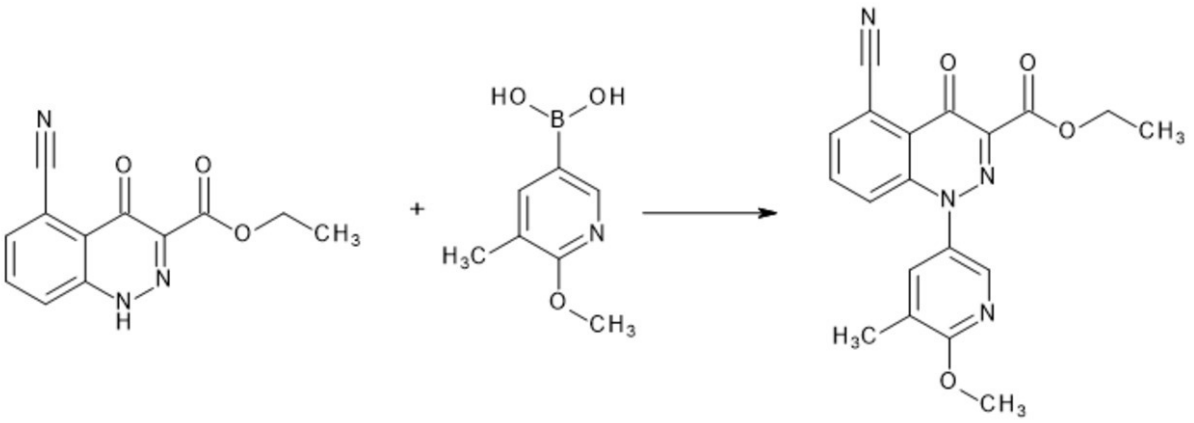


エチル５－ブロモ－４－オキソ－１Ｈ－シノリン－３－カルボキシレート（０．５００ｇ、１．７ｍｍｏｌ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１０ｍＬ）中の溶液に、シアン化亜鉛（０．４００ｇ、３．４ｍｍｏｌ）及びテトラキス（トリフェニル－λ^5－ホスファニル）パラジウム（０．２００ｇ、０．１７ｍｍｏｌ）を添加した。反応混合物をマイクロ波の照射下に１６０℃で４５分間加熱した。反応混合物を水及びジクロロメタン中に分割し、ろ過し、相を分離した。有機相を減圧下で乾燥するまで蒸発させ、粗残渣を、溶離液として水（＋０．１％ギ酸）中に１０～５０％のアセトニトリル（＋０．１％ギ酸）の勾配を用いる逆相Ｃ－１８シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、所望の生成物を薄い黄褐色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（ＤＭＳＯ－ｄ$_6$，４００ＭＨｚ）δ＝８．０２－７．９２（ｍ，１Ｈ），７．８８－７．７４（ｍ，２Ｈ），４．４３（ｑ，２Ｈ），１．４２（ｔ，３Ｈ）．

【０１３７】

ステップ２：エチル５－シアノ－１－（６－メトキシ－５－メチル－３－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物１６）の合成

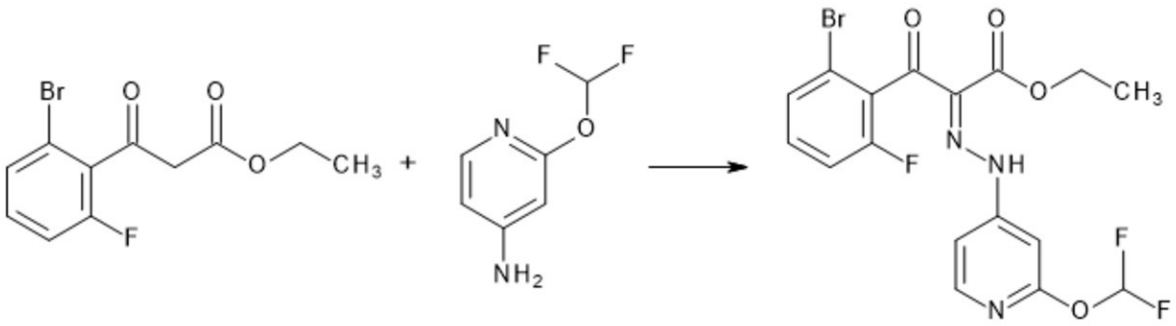
【化２８】



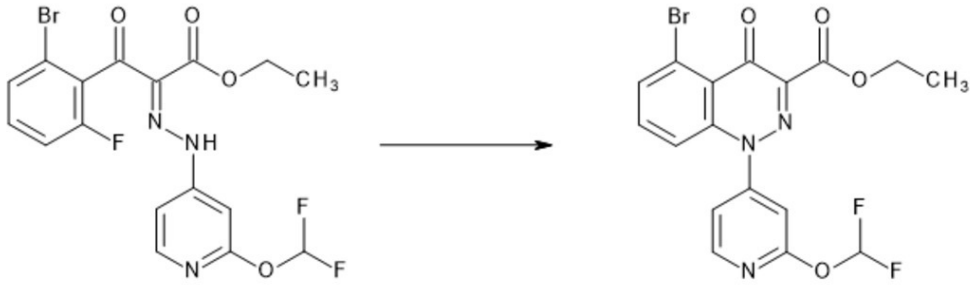
エチル５－シアノ－１－（６－メトキシ－５－メチル－３－ピリジル）－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（０．２００ｇ、０．８３ｍｍｏｌ）のアセトニトリル（６ｍＬ）中の溶液を、（６－メトキシ－５－メチル－３－ピリジル）ボロン酸）に添加し、続いて、アセトニトリル（０．３４ｇ、３．３２ｍｍｏｌ）及び酢酸銅（０．１７ｇ、０．９１ｍｍｏｌ）を添加した。反応混合物を、６０℃で１６時間、圧縮空気の連続流下で加熱した。酢酸エチル（５ｍＬ）及び水（５ｍＬ）を添加して反応混合物を冷却し、相を分離した。水性相を酢酸エチル（２回）中に抽出した。組み合わせた有機抽出物を減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、質量分析逆相ＨＰＬＣにより精製して所望の生成物を得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（５００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝８．１４（ｄ，１Ｈ），７．８６（ｄ，１Ｈ），７．７０（ｄｄ，１Ｈ），７．５０（ｄ，１Ｈ），７．４３（ｄ，１Ｈ），４．４７（ｑ，２Ｈ），４．０６（ｓ，３Ｈ），２．２９（ｓ，３Ｈ），１．４１（ｔ，３Ｈ）．

【０１３８】

実施例６：エチル５－ブロモ－１－［２－（ジフルオロメトキシ）－４－ピリジル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物３８）の合成
ステップ１：エチル（２Ｚ）－３－（２－ブロモ－６－フルオロ－フェニル）－２－［［２－（ジフルオロメトキシ）－４－ピリジル］ヒドラゾノ］－３－オキソ－プロパノエートの合成
【化２９】



２－（ジフルオロメトキシ）ピリジン－４－アミン（０．１１７ｇ、０．７３ｍｍｏｌ）の希釈塩化水素水溶液（２Ｍ、０．５ｍＬ、０．６２ｍｍｏｌ）中の撹拌溶液に、０℃で、亜硝酸ナトリウム（０．０２４ｇ、０．３４ｍｍｏｌ）の水（２ｍＬ）中の溶液を滴下した。得られた反応混合物を０℃で２時間撹拌し、その後、これを、エチル３－（２－ブロモ－６－フルオロ－フェニル）－３－オキソ－プロパノエート（１００ｍｇ、０．３１ｍｍｏｌ）及び酢酸カリウム（０．１５３ｇ、１．５６ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、０℃で添加した。反応混合物を０℃で２時間撹拌し、その後、冷水で希釈し、酢酸エチル（２回）中に抽出した。組み合わせた有機抽出物を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で乾燥するまで蒸発させて、エチル（２Ｚ）－３－（２－ブロモ－６－フルオロ－フェニル）－２－［［２－（ジフルオロメトキシ）－４－ピリジル］ヒドラゾノ］－３－オキソ－プロパノエートを粗固体として得、これを精製せずに次のステップにおいてそのまま用いた。
【０１３９】
ステップ２：エチル５－ブロモ－１－［２－（ジフルオロメトキシ）－４－ピリジル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物３８）の合成
【化３０】



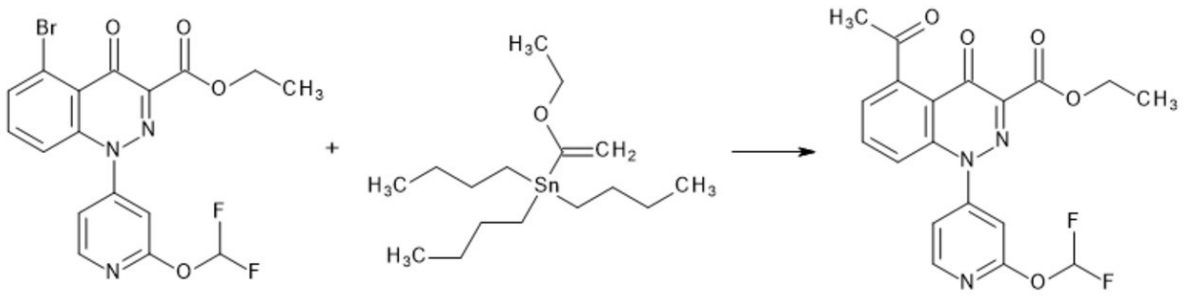
エチル（２Ｚ）－３－（２－ブロモ－６－フルオロ－フェニル）－２－［［２－（ジフルオロメトキシ）－４－ピリジル］ヒドラゾノ］－３－オキソ－プロパノエート（２００ｍｇ、０．３９ｍｍｏｌ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（４ｍＬ）中の撹拌溶液に、炭酸カリウム（０．１０８ｇ、０．７８ｍｍｏｌ）を室温で添加した。得られた反応混合物を１００℃で４時間加熱した。冷却した反応混合物を冷水（５０ｍＬ）で希釈し、酢酸エチル（２回）中に抽出した。組み合わせた有機抽出物を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、溶離液としてヘキサン中の２０％酢酸エチルを用いるシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、エチル５－ブロモ－１－［２－（ジフルオロメトキシ）－４－ピリジル］－４－オキソ－

シノリン－３－カルボキシレートをオフホワイトの固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ＝８．５７（ｄ，１Ｈ），７．７８（ｔ，１Ｈ），７．８１（ｄ，１Ｈ，）７．６４－７．６２（ｍ，１．５Ｈ），７．６１－７．５８（ｄｄ，０．５Ｈ），７．５２（ｄ，１Ｈ），７．３５（ｄｄ，１Ｈ），４．３５（ｑ，２Ｈ），１．２９（ｔ，３Ｈ）．

【０１４０】

実施例７：エチル５－アセチル－１－［２－（ジフルオロメトキシ）－４－ピリジル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物４０）の合成

【化３１】

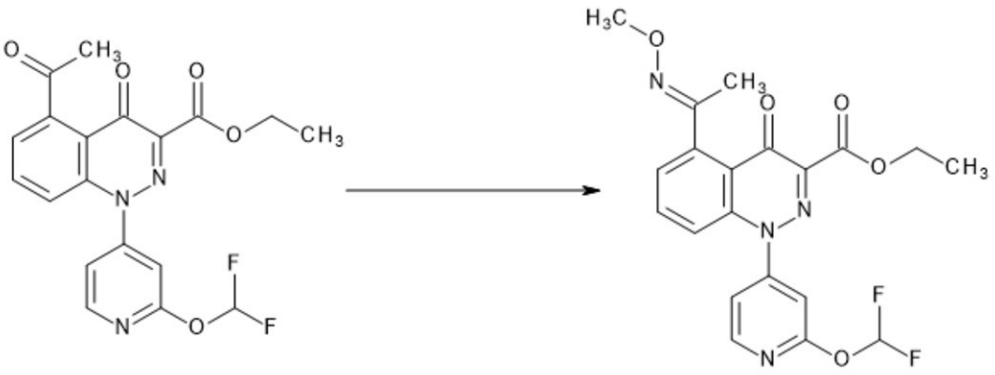


エチル５－ブロモ－１－［２－（ジフルオロメトキシ）－４－ピリジル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（１２０ｍｇ、０．２６ｍｍｏｌ）のトルエン（２０ｍＬ）中の撹拌溶液に、室温で、トリブチル（１－エトキシビニル）スタナン（１８７ｍｇ、０．５２ｍｍｏｌ）を添加した。得られた反応混合物をアルゴンで５分間パージし、その後、ジクロロパラジウム；エチレン；トリフェニルホスフィン（１９ｍｇ、０．０２６ｍｍｏｌ）を添加した。得られた反応混合物を、密閉したチューブ中において、１１０℃で４時間加熱した。この時間の後、冷却した反応混合物を珪藻土でろ過し、ろ液を減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、溶離液としてヘキサン中の１０％酢酸エチルを用いるシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、エチル５－アセチル－１－［２－（ジフルオロメトキシ）－４－ピリジル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレートをオフホワイトの固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ＝８．６０（ｄ，１Ｈ），７．８６－７．６５（ｍ，３Ｈ），７．５６（ｄ，１Ｈ），７．４５（ｄｄ，２Ｈ），４．３５（ｑ，２Ｈ），２．４６（ｓ，３Ｈ），１．３０（ｔ，３Ｈ）．

【０１４１】

実施例８：エチル１－［２－（ジフルオロメトキシ）－４－ピリジル］－５－［（Ｚ）－Ｎ－メトキシ－Ｃ－メチル－カルボンイミドイル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（化合物４１）の合成

【化３２】



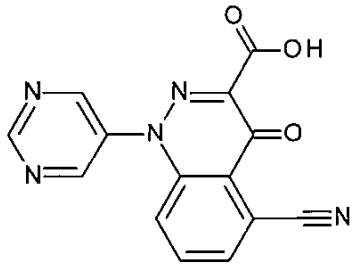
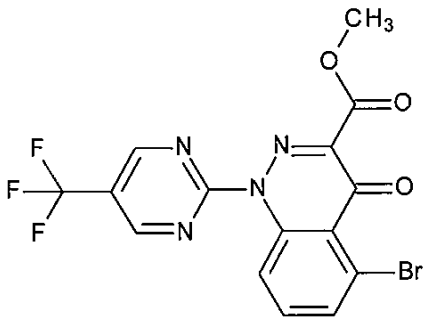
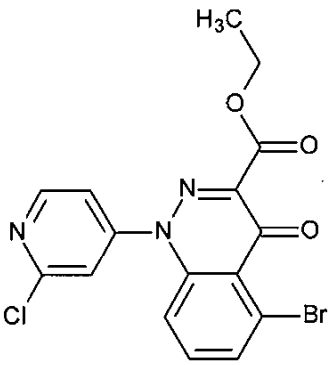
エチル５－アセチル－１－［２－（ジフルオロメトキシ）－４－ピリジル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレート（５０ｍｇ、０．１２ｍｍｏｌ）の、メタノール（

３ｍＬ）及び水（１ｍＬ）の混合物中の撹拌溶液に、０℃で、酢酸ナトリウム（０．０１５ｇ、０．１９ｍｍｏｌ）及びＯ－メチル塩酸ヒドロキシルアミン（０．０１０ｇ、０．１２ｍｍｏｌ）を添加した。得られた反応混合物を５分間撹拌し、その後、８０℃で６時間加熱した。冷却した反応混合物を氷水に注ぎ入れ、塩化水素水溶液（２Ｍ）の添加により中和した。混合物をろ過し、ろ液を減圧下で蒸発させた。粗残渣を、水中に０～１００％のアセトニトリルの勾配を用いる逆相Ｃ－１８シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、エチル１－［２－（ジフルオロメトキシ）－４－ピリジル］－５－［（Ｚ）－Ｎ－メトキシ－Ｃ－メチル－カルボンイミドイル］－４－オキソ－シノリン－３－カルボキシレートをオフホワイトの固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ＝８．５８（ｄ，１Ｈ），８．００（ｓ，０．５Ｈ），７．８２－７．７６（ｍ，１．５Ｈ），７．６６－７．６３（ｍ，１Ｈ），７．５５（ｄ，１Ｈ），７．４５（ｄｄ，１Ｈ），７．３４（ｄｄ，１Ｈ），４．３４（ｑ，２Ｈ），３．８６（ｓ，３Ｈ），２．０７（ｓ，３Ｈ），１．２８（ｔ，３Ｈ）．

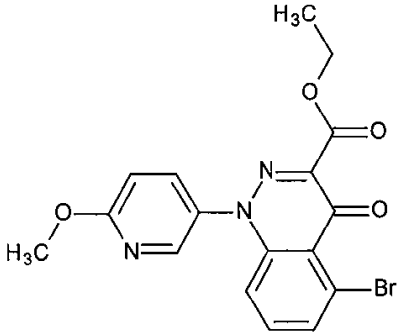
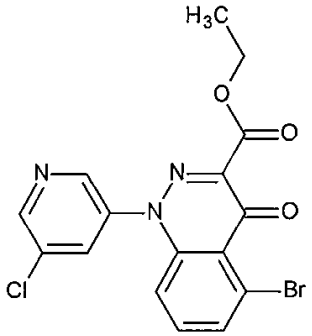
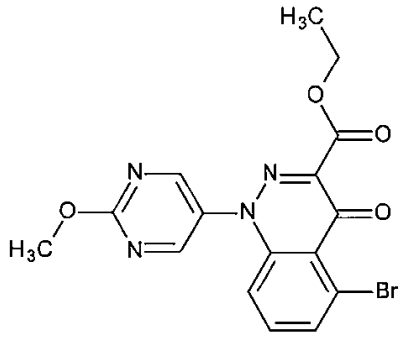
【０１４２】

【表５－１】

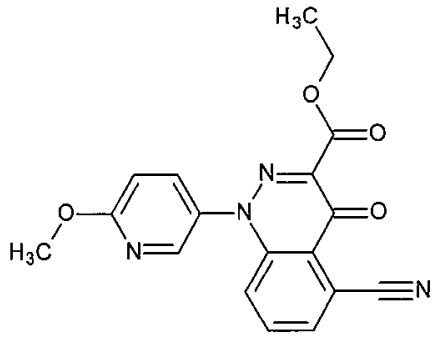
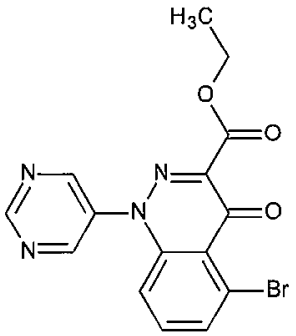
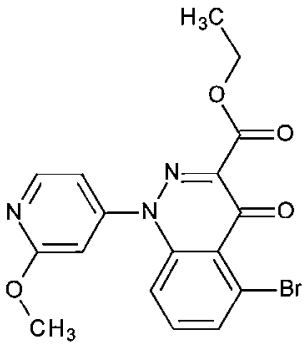
表 2: 本発明に係る選択された化合物の ^{1}H NMR データ。

Cpd No.	化合物名	構造& ^{1}H NMR データ
1	5-シアノ-4-オキソ-1-ピリミジン-5-イル-シノリン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 9.46 (s, 1H), 9.20 (s, 2H), 8.13 (d, 1H), 7.91 (t, 1H), 7.43 (d, 1H)
2	メチル 5-ブロモ-4-オキソ-1-[5-(トリフルオロメチル)ピリミジン-2-イル]シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 9.57 (s, 2H), 7.88 - 7.85 (m, 2H), 7.63 (t, 1H), 3.87 (s, 3H)
3	エチル 5-ブロモ-1-(2-クロロ-4-ピリジル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.65 (d, 1H), 7.76 (dd, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.50 - 7.41 (m, 2H), 7.28 (dd, 1H), 4.46 (q, 2H), 1.42 (t, 3H)

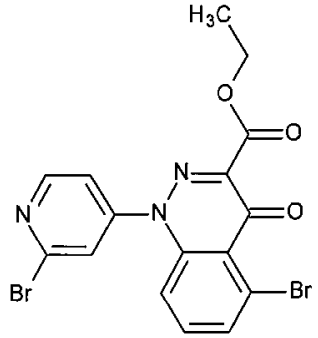
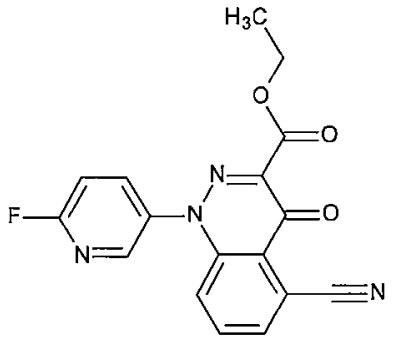
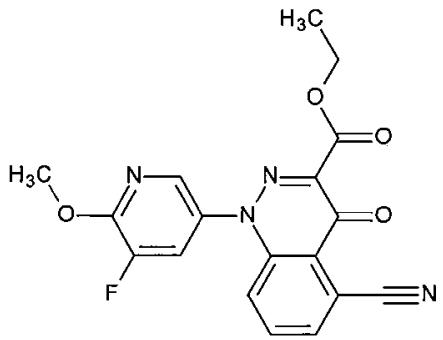
【表５－２】

4	エチル 5-ブロモ-1-(6-メトキシ-3-ピリジル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.31 (d, 1H), 7.72 - 7.66 (m, 2H), 7.39 (dd, 1H), 7.11 (dd, 1H), 6.96 (d, 1H), 4.44 (q, 2H), 4.02 (s, 3H), 1.40 (t, 3H)
5	エチル 5-ブロモ-1-(5-クロロ-3-ピリジル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.77 (d, 1H), 8.69 (d, 1H), 7.92 (t, 1H), 7.73 (dd, 1H), 7.43 (dd, 1H), 7.11 (dd, 1H), 4.45 (q, 2H), 1.41 (t, 3H)
6	エチル 5-ブロモ-1-(2-メトキシピリミジン-5-イル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.68 (s, 2H), 7.78 - 7.71 (m, 1H), 7.43 (dd, 1H), 7.06 (dd, 1H), 4.46 (q, 2H), 4.14 (s, 3H), 1.41 (t, 3H)

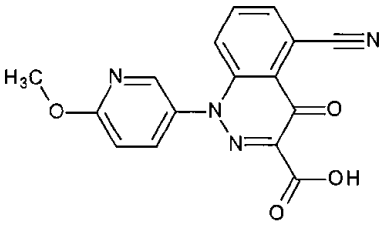
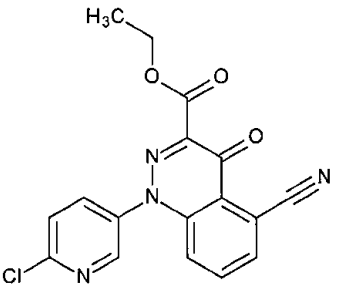
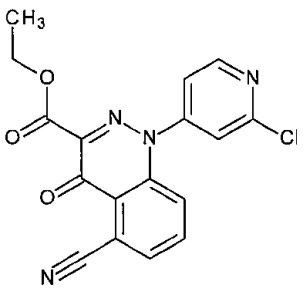
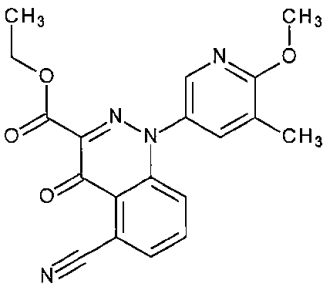
【表５－３】

7	エチル5-シアノ-1-(6-メトキシ-3-ピリジル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.34 (d, 1H), 7.87 (dd, 1H), 7.78 - 7.71 (m, 2H), 7.45 (dd, 1H), 6.98 (d, 1H), 4.45 (q, 2H), 4.04 (s, 3H), 1.41 (t, 3H)
8	エチル 5-ブロモ-4-オキソ-1-ピリミジン-5-イル-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 9.40 (s, 1H), 8.97 (s, 2H), 7.76 (dd, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.08 (dd, 1H), 4.46 (q, 2H), 1.41 (t, 3H)
9	エチル 5-ブロモ-1-(2-メトキシ-4-ピリジル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.39 (d, 1H), 7.71 (dd, 1H), 7.41 (dd, 1H), 7.29 (dd, 1H), 7.04 (dd, 1H), 6.91 (d, 1H), 4.45 (q, 2H), 4.03 (s, 3H), 1.41 (t, 3H)

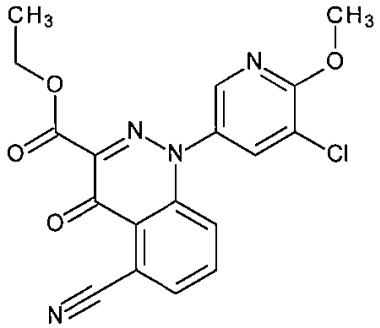
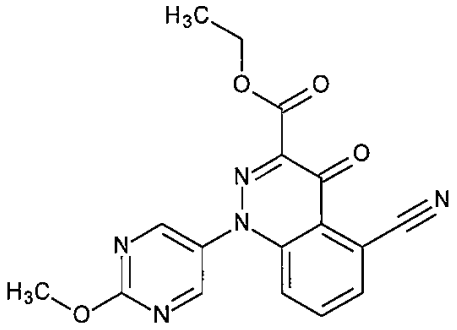
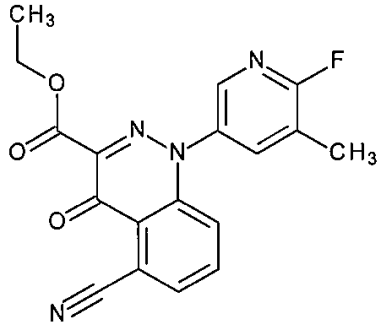
【表５－４】

10	エチル 5-ブロモ-1-(2-ブロモ-4-ピリジル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.63 (d, 1H), 7.76 (dd, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.49 - 7.42 (m, 2H), 7.28 (dd, 1H), 4.47 (q, 2H), 1.42 (t, 3H)
11	エチル5-シアノ-1-(6-フルオロ-3-ピリジル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.47 (d, 1H), 8.08 (ddd, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.82 - 7.77 (m, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.30 - 7.23 (m, 1H), 4.44 (q, 2H), 1.40 (t, 3H)
12	エチル 5-シアノ-1-(5-フルオロ-6-メトキシ-3-ピリジル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.15 (d, 1H), 7.88 (dd, 1H), 7.76 (dd, 1H), 7.55 (dd, 1H), 7.45 (dd, 1H), 4.46 (q, 2H), 4.14 (s, 3H), 1.41 (t, 3H)

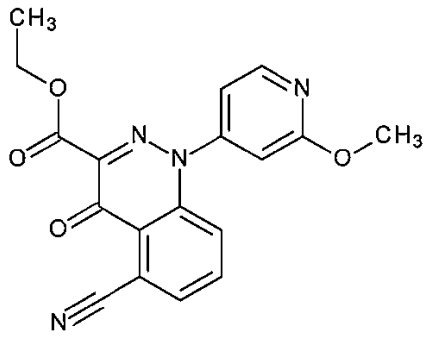
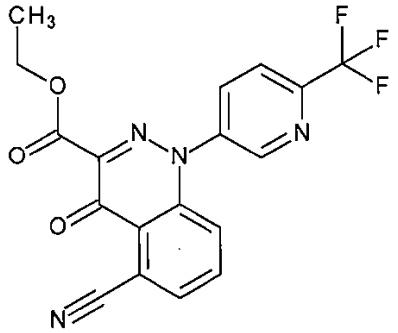
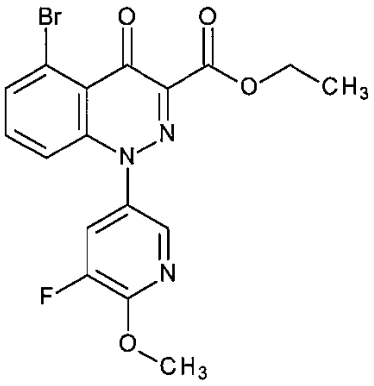
【表５－５】

13	5-シアノ-1-(6-メトキシ-3-ピリジル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.35 (d, 1H), 8.08 (dd, 1H), 7.72 (dd, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 6.95 - 6.88 (m, 1H), 4.05 (s, 3H)
14	エチル 1-(6-クロロ-3-ピリジル)-5-シアノ-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, クロロホルム) δ = 8.61 (d, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.85 (dd, 1H), 7.76 (dd, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.41 (d, 1H), 4.47 (q, 2H), 1.42 (t, 3H)
15	エチル 1-(2-クロロ-4-ピリジル)-5-シアノ-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, クロロホルム) δ = 8.69 (d, 1H), 7.92 (d, 1H), 7.79 (t, 1H), 7.62 - 7.57 (m, 2H), 7.45 (dd, 1H), 4.48 (q, 2H), 1.42 (t, 3H)
16	エチル5-シアノ-1-(6-メトキシ-5-メチル-3-ピリジル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, クロロホルム) δ = 8.14 (d, 1H),

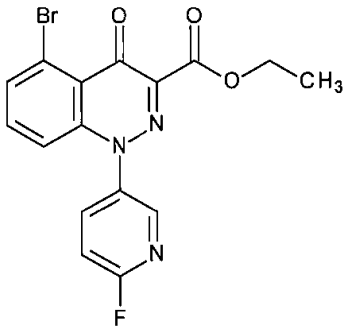
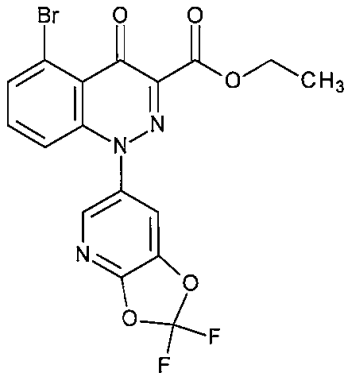
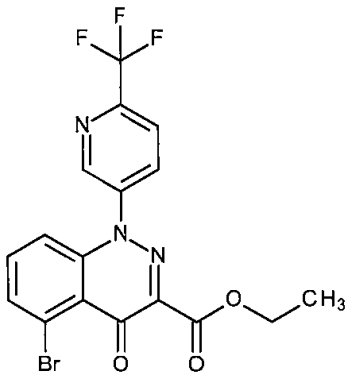
【表５－６】

		7.86 (d, 1H), 7.70 (dd, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 4.47 (q, 2H), 4.06 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 1.41 (t, 3H)
17	エチル 1-(5-クロロ-6-メトキシ-3-ピリジル)-5-シアノ-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, クロロホルム) δ = 8.24 (d, 1H), 7.89 (dd, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.42 (dd, 1H), 4.47 (q, 2H), 4.13 (s, 3H), 1.42 (t, 3H)
18	エチル 5-シアノ-1-(2-メトキシピリミジン-5-イル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, クロロホルム) δ = 8.70 (s, 2H), 7.91 (dd, 1H), 7.77 (dd, 1H), 7.38 (d, 1H), 4.48 (q, 2H), 4.15 (s, 3H), 1.42 (t, 3H)
19	エチル5-シアノ-1-(6-フルオロ-5-メチル-3-ピリジル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, クロロホルム) δ = 8.24 (s, 1H), 7.89 (d, 1H), 7.79 (dd, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.39 (d, 1H), 4.47 (q, 2H), 2.43 (s, 3H), 1.42 (t, 3H)

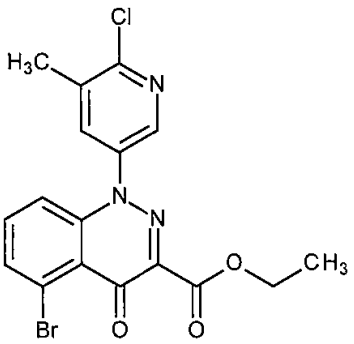
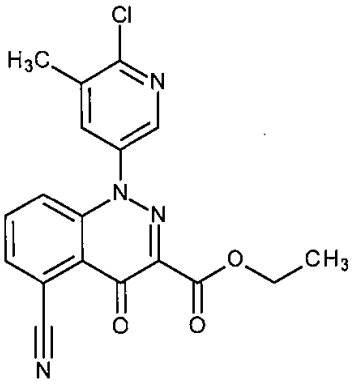
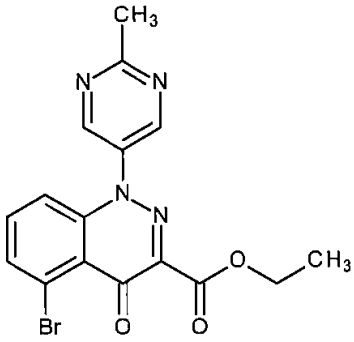
【表５－７】

20	エチル 5-シアノ-1-(2-メトキシ-4-ピリジル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, クロロホルム) δ = 8.42 (d, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.73 (dd, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 6.91 (d, 1H), 4.47 (q, 2H), 4.04 (s, 3H), 1.42 (t, 3H)
21	エチル 5-シアノ-4-オキソ-1-[6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, クロロホルム) δ = 8.94 (d, 1H), 8.11 (dd, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.92 (d, 1H), 7.77 (t, 1H), 7.47 - 7.42 (m, 1H), 4.48 (q, 2H), 1.42 (t, 3H)
22	エチル 5-ブロモ-1-(5-フルオロ-6-メトキシ-3-ピリジル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.12 (d, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.50 (dd, 1H), 7.40 (t, 1H), 7.10 (d, 1H), 4.45 (q, 2H), 4.13 (s, 3H), 1.41 (t, 3H)

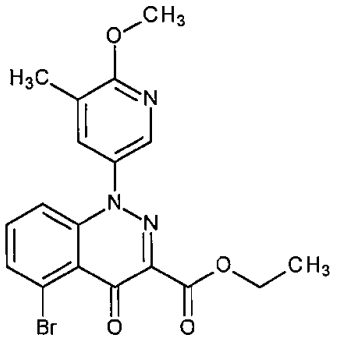
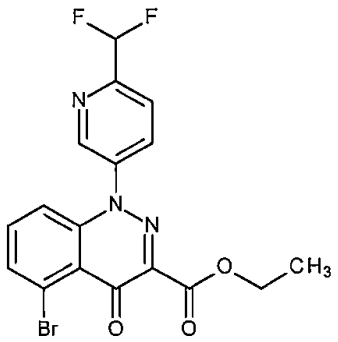
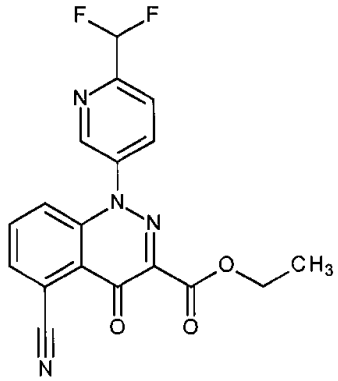
【表５－８】

23	エチル 5-ブロモ-1-(6-フルオロ-3-ピリジル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.42 (d, 1H), 7.95 (ddd, 1H), 7.73 (dd, 1H), 7.41 (dd, 1H), 7.21 (dd, 1H), 7.05 (dd, 1H), 4.46 (q, 2H), 1.41 (t, 3H)
24	エチル 5-ブロモ-1-(2,2-ジフルオロ-[1,3]ジオキソロ[4,5-b]ピリジン-6-イル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.16 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.43 (t, 1H), 7.09 (d, 1H), 4.44 (q, 2H), 1.40 (t, 3H)
25	エチル5-ブロモ-4-オキソ-1-[6-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 9.10 (d, 1H), 8.47 (dd, 1H), 8.26 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.57 (t, 1H), 7.29 (d, 1H), 4.33 (q, 2H), 1.29 (t, 3H)

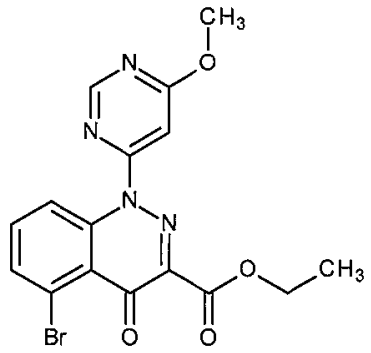
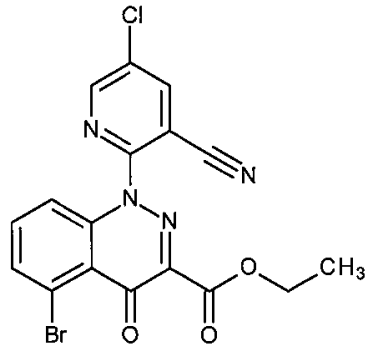
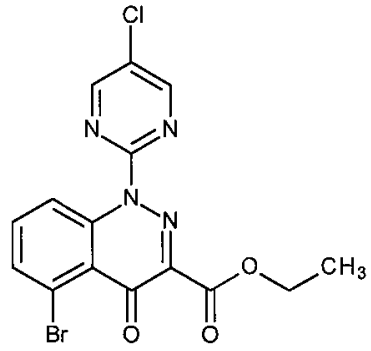
【表５－９】

26	エチル5-ブロモ-1-(6-クロロ-5-メチル-3-ピリジル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.59 (d, 1H), 8.20 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.57 (t, 1H), 7.25 (d, 1H), 4.32 (q, 2H), 2.44 (s, 3H), 1.29 (t, 3H)
27	エチル1-(6-クロロ-5-メチル-3-ピリジル)-5-シアノ-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.60 (d, 1H), 8.21 (d, 1H), 8.11 (d, 1H), 7.89 (dd, 1H), 7.64 (d, 1H), 4.35 (1, 2H), 2.45 (s, 3H), 1.30 (t, 3H)
28	エチル5-ブロモ-1-(2-メチルピリミジン-5-イル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 9.05 (s, 2H), 7.82 (d, 1H), 7.57 (t, 1H), 7.29 (d, 1H), 4.33 (q, 2H), 2.78 (s, 3H), 1.29 (t, 3H)

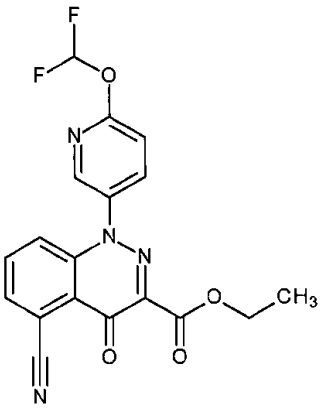
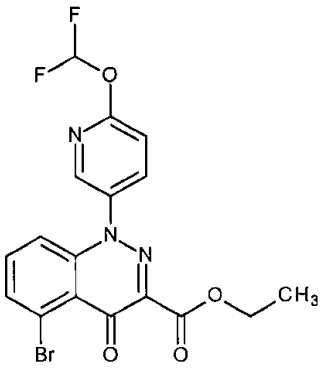
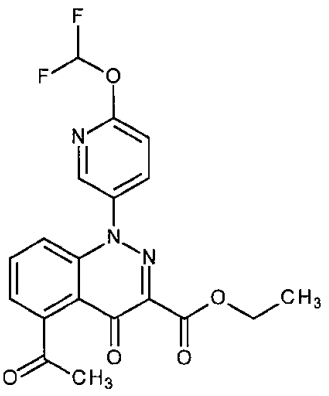
【表５－１０】

29	エチル5-ブロモ-1-(6-メトキシ-5-メチル-3-ピリジル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 9.05 (s, 2H), 7.82 (d, 1H), 7.57 (t, 1H), 7.29 (d, 1H), 4.33 (q, 2H), 2.78 (s, 3H), 1.29 (t, 3H)
30	エチル5-ブロモ-1-[6-(ジフルオロメチル)-3-ピリジル]-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 9.01 (d, 1H), 8.37 (dd, 1H), 8.03 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.57 (t, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.13 (br t, 1H), 4.33 (q, 2H), 1.29 (t, 3H)
31	エチル5-シアノ-1-[6-(ジフルオロメチル)-3-ピリジル]-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 9.02 (d, 1H), 8.38 (dd, 1H), 8.12 (d, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.89 (dd, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.13 (br t, 1H), 4.35 (q, 2H), 1.30 (t, 3H)

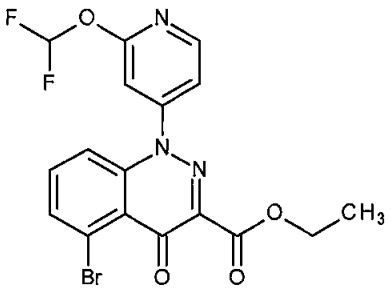
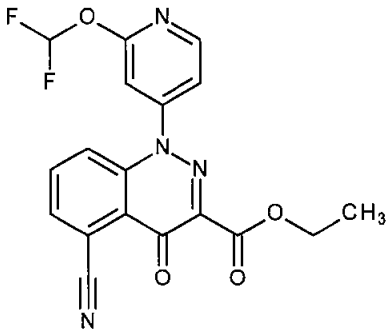
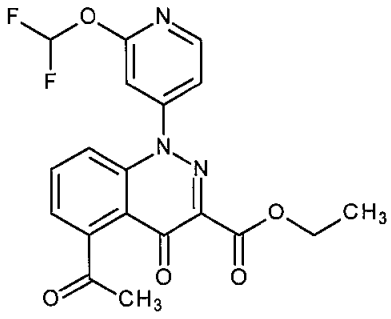
【表５－１１】

32	エチル5-ブロモ-1-(6-メトキシピリミジン-4-イル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, クロロホルム) δ = 8.78 (s, 1H), 7.94 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.45 (t, 1H), 7.13 (s, 1H), 4.47 (q, 2H), 4.10 (s, 3H), 1.42 (t, 3H)
33	エチル5-ブロモ-1-(5-クロロ-3-シアノ-2-ピリジル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, クロロホルム) δ = 8.75 (d, 1H), 8.27 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.43 (t, 1H), 7.26 (d, 1H), 4.46 (q, 2H), 1.41 (t, 3H)
34	エチル5-ブロモ-1-(5-クロロピリミジン-2-イル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, クロロホルム) δ = 8.90 (s, 2H), 7.74 (d, 1H), 7.51 (d, 1H), 7.42 (t, 1H), 4.46 (q, 2H), 1.41 (t, 3H)

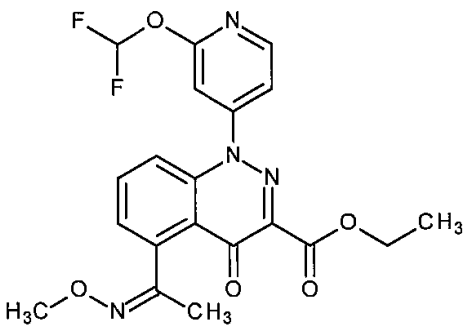
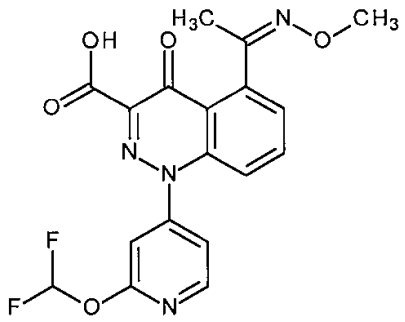
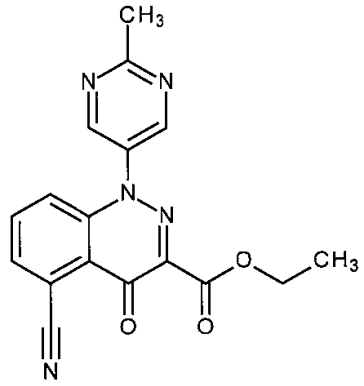
【表５－１２】

35	エチル5-シアノ-1-[6-(ジフルオロメトキシ)-3-ピリジル]-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.67 (d, 1H), 8.28 (dd, 1H), 8.11 (dd, 1H), 7.91 - 7.87 (m, 1H), 7.75 (t, 1H), 7.57 (dd, 1H), 7.42 (d, 1H), 4.35 (q, 2H), 1.30 (t, 3H)
36	エチル5-ブロモ-1-[6-(ジフルオロメトキシ)-3-ピリジル]-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.62 (s, 1H), 8.28 (dd, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.59 (dd, 1.5H), 7.41 (d, 1.5H), 7.18 (dd, 1H), 4.33 (q, 2H), 1.28 (t, 3H)
37	エチル5-アセチル-1-[6-(ジフルオロメトキシ)-3-ピリジル]-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.65 (d, 1H), 8.31

【表５－１３】

		(dd, 1H), 7.84 - 7.80 (m, 2H), 7.41 (t, 2H), 7.30 (d, 1H), 4.32 (q, 2H), 2.46 (s, 3H), 1.28 (t, 3H)
38	エチル5-ブロモ-1-[2-(ジフルオロメトキシ)-4-ピリジル]-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.57 (d, 1H), 7.78 (t, 1H), 7.81 (d, 1H,) 7.64 - 7.62 (m, 1.5H), 7.61 - 7.58 (dd, 0.5H), 7.52 (d, 1H), 7.35 (dd, 1H), 4.35 (q, 2H), 1.29 (t, 3H)
39	エチル5-シアノ-1-[2-(ジフルオロメトキシ)-4-ピリジル]-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.60 (d, 1H), 8.13 (dd, 1H), 7.99 - 7.89 (m, 1.5 H), 7.81 (d, 0.5H), 7.75 (dd, 1H), 7.63 (dd, 1H), 7.51 (d, 1H), 4.35 (q, 2H), 1.30 (t, 3H)
40	エチル5-アセチル-1-[2-(ジフルオロメトキシ)-4-ピリジル]-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.60 (d, 1H), 7.86 - 7.65 (m, 3H), 7.56 (d, 1H), 7.45 (dd, 2H), 4.35 (q, 2H), 2.46 (s, 3H), 1.30 (t, 3H)

【表５－１４】

41	エチル1-[2-(ジフルオロメトキシ)-4-ピリジル]-5-[(Z)-N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル]-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.58 (d, 1H), 8.00 (s, 0.5H), 7.82 - 7.76 (m, 1.5H), 7.66 - 7.63 (m, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.34 (dd, 1H), 4.34 (q, 2H), 3.86 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.28 (t, 3H)
42	1-[2-(ジフルオロメトキシ)-4-ピリジル]-5-[(Z)-N-メトキシ-C-メチル-カルボンイミドイル]-4-オキソ-シノリン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ = 8.57 (d, 1H), 8.00 - 7.75 (m, 2H), 7.64 - 7.61 (m, 1H), 7.51 - 7.50 (m, 2H), 7.31 (d, 1H), 3.86 (s, 3H), 2.07 (s, 3H)
43	エチル5-シアノ-1-(2-メチルピリミジン-5-イル)-4-オキソ-シノリン-3-カルボキシレート	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 9.05 (s, 2H), 8.12 (d, 1H), 7.90 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 4.35 (q, 2H), 2.79 (s, 3H), 1.30 (t, 3H)

【０１４３】

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（アオゲイトウ（Ａｍａｒａｎｔｈｕｓ ｒｅｔｏｆｌｅｘｕｓ）（ＡＭＡＲＥ）、イヌビエ（Ｅｃｈｉｎｏｃｈｌｏａ ｃｒｕｓ－ｇａｌｌｉ）（ＥＣＨＣＧ）、オオホナガアオゲイトウ（Ａｍａｒａｎｔｈｕｓ ｐａｌｍｅｒｉ）（ＡＭＡＰＡ）、アキノエノコログサ（Ｓｅｔａｒｉａ ｆａｂｅｒｉ）（ＳＥＴＦＡ）、トウモロコシ（Ｚｅａ ｍａｙｓ）（ＺＥＡＭＸ）、アメリカアサガオ（Ｉｐｏｍｏｅａ ｈｅｄｅｒａｃｅａ）（ＩＰＯＨＥ））。温室中において制御された条件下（２４℃／１６℃、昼／夜；１４時間の明かり；６５％湿度）で８日間栽培

した後、これらの植物に、０．５％のＴｗｅｅｎ　２０（モノラウリン酸ポリオキシエチレンソルビタン、ＣＡＳ　ＲＮ９００５－６４－５）を含有するアセトン／水（５０：５０）溶液中の技術的有効成分の配合物から得られる噴霧水溶液を噴霧する。別段の記載がある場合を除き、化合物は１０００ｇ／ｈで適用する。次いで、テスト植物を、温室中において、制御された温室中の条件下（２４℃／１６℃、昼／夜；１４時間の明かり；６５％湿度）で１日２回水を与えて栽培する。１３日後、植物に生じた損傷割合についてテストを評価する。生物学的活性を以下の表において５点のスケール（５＝８１～１００％；４＝６１～８０％；３＝４１～６０％；２＝２１～４０％；１＝１０～２０％；０＝０％；－＝テストせず）で示す。

【０１４４】

【表６】

表 B1: 発芽前テスト

Cpd No.	AMARE	ECHCG	AMAPA	SETFA	ZEAMX	IPOHE
1	0	2	0	0	0	0
10	1	-	0	0	0	0
23	0	5	0	4	0	1
26	1	0	1	-	0	0
30	0	2	0	-	0	0
32	0	1	0	1	0	0
34	0	0	1	1	0	0
36	0	0	1	1	1	0
37	0	4	0	-	4	0
40	0	3	0	-	0	0
41	0	4	0	-	1	0

【０１４５】

【表７】

表 B2: 発芽後テスト

Cpd No.	AMARE	ECHCG	AMAPA	SETFA	ZEAMX	IPOHE
1	2	2	1	1	1	1
3	2	2	1	0	0	0
4	2	0	1	0	0	0
5	1	2	1	2	1	1
8	0	0	0	0	0	0
9	1	1	1	0	1	0
10	3	1	3	0	0	0
11	0	2	0	0	1	0
22	0	0	0	0	0	0
23	0	4	0	4	1	0
24	0	2	0	2	1	0
26	2	0	1	1	–	2
29	2	1	1	0	–	2
30	1	4	1	0	–	2
32	1	0	1	0	0	1
33	0	1	–	1	0	1
34	3	0	1	2	1	3
35	1	0	1	0	–	1
36	2	0	0	1	0	1
37	1	4	0	1	–	2
38	2	0	1	1	–	2
40	1	4	0	1	–	1
41	1	2	1	1	–	1

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2022/082045

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. C07D401/04 C07D403/04 C07D409/04 C07D491/056 A01N43/58
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

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 0 320 793 A (SUMITOMO CHEMICAL CO. LTD.) 21 June 1989 (1989-06-21) claims; examples	1-15
A	US 5 129 939 A (LABOWITZ ET. AL.) 14 July 1992 (1992-07-14) claims; examples	1-15
A	EP 0 363 236 A (LAFARGE COPPICE) 11 April 1990 (1990-04-11) claims; examples	1-15
X,P	WO 2021/233786 A1 (SYNGENTA CROP PROTECTION AG) 25 November 2021 (2021-11-25) page 68 - page 70; claims	1-15

☐ 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	Date of mailing of the international search report
25 January 2023	02/02/2023

Name and mailing address of the ISA/	Authorized officer
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Helps, Ian

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2022/082045

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 320793 A	21-06-1989	AU 2659888 A	22-06-1989
		DE 3880988 T2	16-09-1993
		EP 0320793 A2	21-06-1989
		ES 2056883 T3	16-10-1994
		KR 890009882 A	04-08-1989
US 5129939 A	14-07-1992	NONE	
EP 363236 A	11-04-1990	AT 115135 T	15-12-1994
		CA 1338738 C	26-11-1996
		CN 1041087 A	11-04-1990
		DE 68919797 T2	04-05-1995
		EP 0363236 A1	11-04-1990
		ES 2065407 T3	16-02-1995
		HK 127295 A	18-08-1995
		JP 2771627 B2	02-07-1998
		JP H0356468 A	12-03-1991
		US 5332716 A	26-07-1994
		US 5696055 A	09-12-1997
WO 2021233786 A1	25-11-2021	AR 122103 A1	10-08-2022
		AU 2021276067 A1	15-12-2022
		BR 112022023491 A2	20-12-2022
		UY 39218 A	31-12-2021
		WO 2021233786 A1	25-11-2021

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (April 2005)

フロントページの続き

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,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,ME,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．ＴＷＥＥＮ

(74)代理人　100212509
弁理士　太田 知子
(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　ウォーリー ルイーザ
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 ゾーイ 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

Ｆターム（参考）　4H011　AB01 BB09