

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第5475660号
(P5475660)

(45) 発行日 平成26年4月16日(2014.4.16)

(24) 登録日 平成26年2月14日(2014.2.14)

(51) Int.Cl.

C07D 491/107 (2006.01)
A01P 13/00 (2006.01)
A01P 7/02 (2006.01)
A01P 7/04 (2006.01)
A01N 43/36 (2006.01)

F 1

C07D 491/107 C S P
AO1P 13/00
AO1P 7/02
AO1P 7/04
AO1N 43/36 C

請求項の数 22 (全 156 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2010-518536 (P2010-518536)
(86) (22) 出願日 平成20年7月22日 (2008.7.22)
(65) 公表番号 特表2010-535161 (P2010-535161A)
(43) 公表日 平成22年11月18日 (2010.11.18)
(86) 國際出願番号 PCT/EP2008/005973
(87) 國際公開番号 WO2009/015801
(87) 國際公開日 平成21年2月5日 (2009.2.5)
審査請求日 平成23年7月21日 (2011.7.21)
(31) 優先権主張番号 07113674.1
(32) 優先日 平成19年8月2日 (2007.8.2)
(33) 優先権主張国 歐州特許庁 (EP)

(73) 特許権者 507203353
バイエル・クロップサイエンス・アーゲー
BAYER CROPSCIENCE AG
ドイツ国、40789・モンハイム、アル
フレート-ノベル-シュトラーゼ・50
(74) 代理人 110001173
特許業務法人川口國際特許事務所
(74) 代理人 100140523
弁理士 渡邊 千尋
(74) 代理人 100103920
弁理士 大崎 勝真
(74) 代理人 100124855
弁理士 坪倉 道明

最終頁に続く

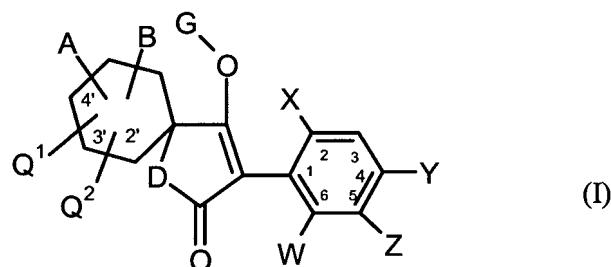
(54) 【発明の名称】オキサスピロ環式スピロ置換テトラミン酸及びテトロン酸誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(I)

【化 1】



10

〔式中、

Wは、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、置換されていても良いシクロアルキル、ハロゲン、アルコキシ、アルケニルオキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ又はシアノを表し、

Xは、ハロゲン、アルキル、アルケニル、アルキニル、置換されていても良いシクロアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルケニルオキシ、ニトロ又はシア

20

ノを表し、

Y及びZは、互いに独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、置換されていても良いシクロアルキル、アルコキシ、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、シアノ若しくはニトロを表すか、又は、それぞれ置換されていても良いアリール若しくはヘタリールを表し、

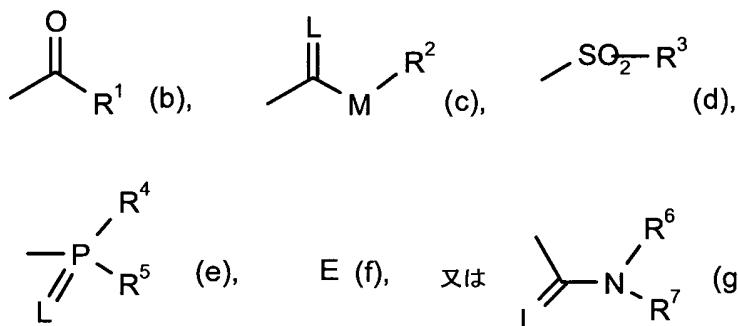
A及びBは、シクロヘキサン環の4'位の炭素原子と一緒にテトラヒドロフラン環を表し、その酸素原子は4'位の炭素原子に直接結合しており、

Dは、NH又は酸素を表し、

Q¹、Q²は、互いに独立して、水素、アルキル、ハロアルキル又はアルコキシを表し、

Gは、水素(a)を表すか、又は、以下の基

【化2】



のうちの1つを表し、

ここで、

Eは、金属イオン又はアンモニウムイオンを表し、

Lは、酸素又は硫黄を表し、

Mは、酸素又は硫黄を表し、

R¹は、それぞれハロゲン若しくはシアノで置換されていても良いアルキル、アルケニル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル若しくはポリアルコキシアルキルを表すか、又は、それぞれハロゲン、アルキル若しくはアルコキシで置換されていても良いシクロアルキル若しくはヘテロシクリルを表すか、又は、それぞれ置換されていても良いフェニル、フェニルアルキル、ヘタリール、フェノキシアルキル若しくはヘタリールオキシアリルを表し、

R²は、それぞれハロゲン若しくはシアノで置換されていても良いアルキル、アルケニル、アルコキシアルキル若しくはポarialコキシアルキルを表すか、又は、それぞれ置換されていても良いシクロアルキル、フェニル若しくはベンジルを表し、

R³、R⁴及びR⁵は、互いに独立して、それぞれハロゲンで置換されてもよいアルキル、アルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルチオ、アルケニルチオ若しくはシクロアルキルチオを表すか、又は、それぞれ置換されていても良いフェニル、ベンジル、フェノキシ若しくはフェニルチオを表し、

R⁶及びR⁷は、互いに独立して、水素を表し、それぞれハロゲン若しくはシアノで置換されていても良いアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルコキシ、アルコキシアリルを表し、それぞれ置換されていても良いフェニル若しくはベンジルを表すか、又は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、置換されていても良い環{該環は、酸素又は硫黄を含んでいても良い}を形成している]の化合物。

【請求項2】

Wが、水素、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニルを表し、C₃-C₆-シクロアルキル{該シクロアルキルは、C₁-C₂-アルキル、C₁-C₂-アルコキシ、フッ素、塩素、トリフルオロメチル又はC₃-C₆-シクロア

10

20

30

40

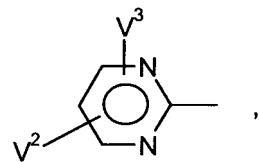
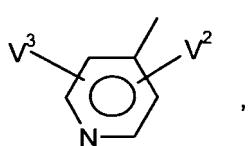
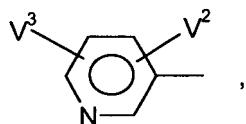
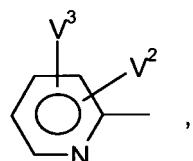
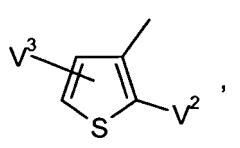
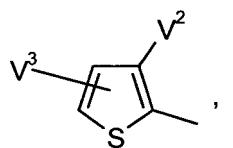
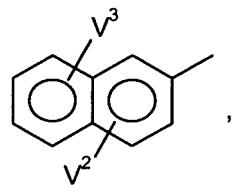
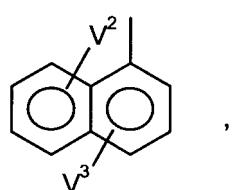
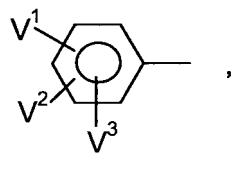
50

ルキルで一置換又は二置換されていても良い}を表し、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ若しくはシアノを表し、

Xが、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニルを表し、C₃ - C₆ - シクロアルキル {該シクロアルキルは、C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₂ - アルコキシ、フッ素、塩素、トリフルオロメチル又はC₃ - C₆ - シクロアルキルで一置換又は二置換されていても良い}を表し、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₃ - C₆ - アルケニルオキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ、C₃ - C₆ - ハロアルケニルオキシ、ニトロ若しくはシアノを表し、

Y及びZが、互いに独立して、水素、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニルを表し、C₃ - C₆ - シクロアルキル {該シクロアルキルは、C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₂ - アルコキシ、フッ素、塩素、トリフルオロメチル又はC₃ - C₆ - シクロアルキルで一置換又は二置換されていても良い}を表し、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ、シアノ、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニルを表すか、又は、(ヘタ)アリール基

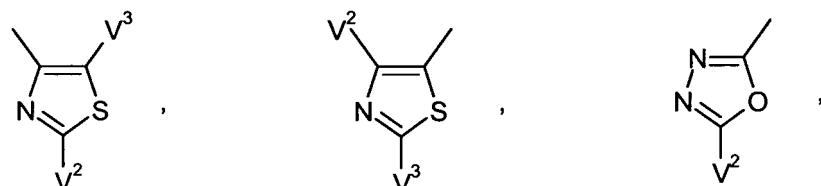
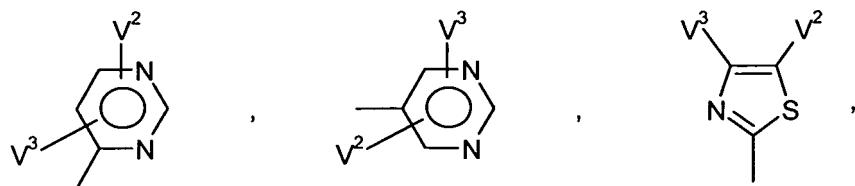
【化3】



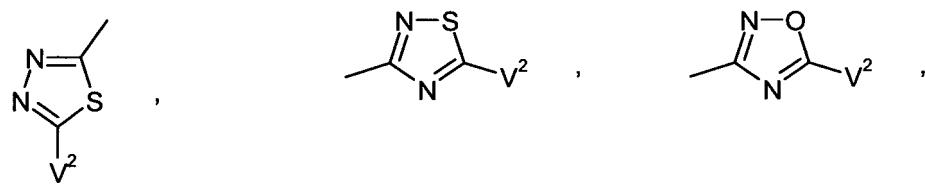
10

20

30



10



20



のうちの1つを表し { (ヘタ)アリールの場合、基Y又はZの一方のみが(ヘタ)アリールを表すことができる}、

V¹が、水素、ハロゲン、C₁ - C_{1,2} - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、ニトロ、シアノを表すか、又は、フェニル、フェノキシ、フェノキシ-C₁ - C₄ - アルキル、フェニル-C₁ - C₄ - アルコキシ、フェニルチオ-C₁ - C₄ - アルキル若しくはフェニル-C₁ - C₄ - アルキルチオ {これらは、それぞれ、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、ニトロ又はシアノで一置換又は多置換されていても良い} を表す、

V²及びV³が、互いに独立して、水素、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルキル又はC₁ - C₄ - ハロアルコキシを表す、

A及びBは、シクロヘキサン環の4'位の炭素原子と一緒にテトラヒドロフラン環を表し、その酸素原子は4'位の炭素原子に直接結合しており、

Dが、NH(1)又は酸素(2)を表す、

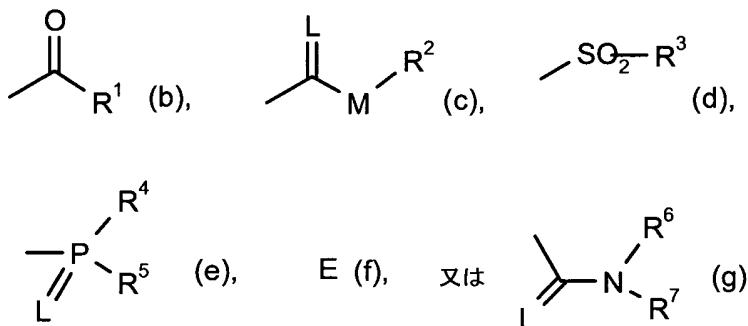
Q¹及びQ²が、互いに独立して、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₂ - ハロアルキル又はC₁ - C₄ - アルコキシを表す、

Gが、水素(a)を表すか、又は、以下の基

30

40

【化4】



10

のうちの1つを表し、

ここで、

Eが、金属イオン又はアンモニウムイオンを表し、

Lが、酸素又は硫黄を表し、並びに

Mが、酸素又は硫黄を表し、

R¹が、それぞれハロゲン若しくはシアノで置換されていても良いC₁-C₂₀-アルキル、C₂-C₂₀-アルケニル、C₁-C₈-アルコキシ-C₁-C₈-アルキル、C₁-C₈-アルキルチオ-C₁-C₈-アルキル若しくはポリ-C₁-C₈-アルコキシ-C₁-C₈-アルキルを表すか、又は、ハロゲン、C₁-C₆-アルキル若しくはC₁-C₆-アルコキシで置換されていても良いC₃-C₈-シクロアルキル{1つ又は2つの直接には隣接していないメチレン基は酸素及び/又は硫黄で置き換えられていても良い}を表し、

ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ又はC₁-C₆-アルキルスルホニルで置換されていても良いフェニルを表し、

ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルキル又はC₁-C₆-ハロアルコキシで置換されていても良いフェニル-C₁-C₆-アルキルを表し、

ハロゲン又はC₁-C₆-アルキルで置換されていても良い5員又は6員のヘタリール{該ヘタリールは、酸素、硫黄及び窒素からなる群の1個又は2個のヘテロ原子を有している}を表し、

ハロゲン又はC₁-C₆-アルキルで置換されていても良いフェノキシ-C₁-C₆-アルキルを表し、又は、

ハロゲン、アミノ又はC₁-C₆-アルキルで置換されていても良い5員又は6員のヘタリールオキシ-C₁-C₆-アルキル{該ヘタリールオキシ-C₁-C₆-アルキルは、酸素、硫黄及び窒素からなる群からの1個又は2個のヘテロ原子を有している}を表し、

R²が、それぞれハロゲン又はシアノで置換されていても良いC₁-C₂₀-アルキル、C₂-C₂₀-アルケニル、C₁-C₈-アルコキシ-C₂-C₈-アルキル又はポリ-C₁-C₈-アルコキシ-C₂-C₈-アルキルを表し、

ハロゲン、C₁-C₆-アルキル又はC₁-C₆-アルコキシで置換されていても良いC₃-C₈-シクロアルキルを表し、又は、

それぞれハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルキル又はC₁-C₆-ハロアルコキシで置換されていても良いフェニル又はベンジルを表し、

R³が、ハロゲンで置換されていても良いC₁-C₈-アルキル、又は、それぞれハロゲン、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-ハロアルコキシ、シアノ若しくはニトロで置換されていても良いフェニル若しくはベンジルを表し、

20

30

40

50

R⁴ 及び R⁵ が、互いに独立して、それぞれハロゲンで置換されていても良い C₁ - C₈ - アルキル、C₁ - C₈ - アルコキシ、C₁ - C₈ - アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₈ - アルキル) アミノ、C₁ - C₈ - アルキルチオ若しくは C₃ - C₈ - アルケニルチオを表すか、又は、それぞれハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、C₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、C₁ - C₄ - アルキル若しくは C₁ - C₄ - ハロアルキルで置換されていても良いフェニル、フェノキシ若しくはフェニルチオを表し、

R⁶ 及び R⁷ が、互いに独立して、水素を表し、それぞれハロゲン若しくはシアノで置換されていても良い C₁ - C₈ - アルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル、C₁ - C₈ - アルコキシ、C₃ - C₈ - アルケニル若しくは C₁ - C₈ - アルコキシ - C₂ - C₈ - アルキルを表し、それぞれハロゲン、C₁ - C₈ - アルキル、C₁ - C₈ - ハロアルキル若しくは C₁ - C₈ - アルコキシで置換されていても良いフェニル若しくはベンジルを表すか、又は、一緒になって、C₁ - C₆ - アルキルで置換されていても良い C₃ - C₆ - アルキレン基 (1つのメチレン基は、酸素又は硫黄で置き換えられていても良い] を表す、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

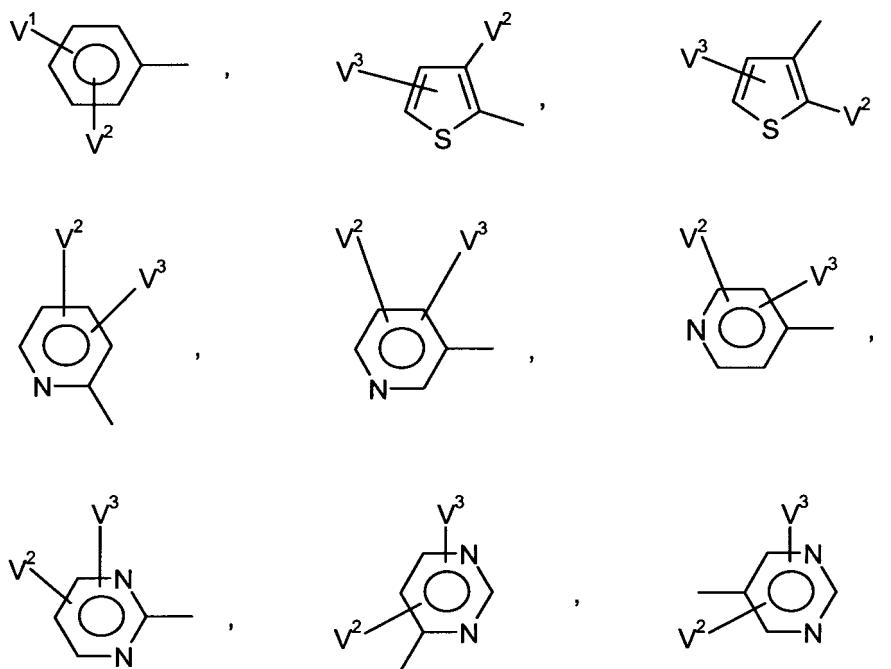
【請求項 3】

W が、水素、塩素、臭素、C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - アルキニルを表し、C₃ - C₆ - シクロアルキル {該シクロアルキルは、メチル、エチル、メトキシ、フッ素、塩素、トリフルオロメチル又はシクロプロピルで一置換されていても良い} を表し、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₂ - ハロアルキル若しくは C₁ - C₂ - ハロアルコキシを表し、

X が、塩素、臭素、C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - アルキニルを表し、C₃ - C₆ - シクロアルキル {該シクロアルキルは、メチル、エチル、メトキシ、フッ素、塩素、トリフルオロメチル又はシクロプロピルで一置換されていても良い} を表し、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ若しくはシアノを表し、

Y 及び Z が、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - アルキニルを表し、C₃ - C₆ - シクロアルキル {該シクロアルキルは、メチル、エチル、メトキシ、フッ素、塩素、トリフルオロメチル又はシクロプロピルで一置換されていても良い} を表し、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、シアノ、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - アルキニルを表すか、又は、(ヘタ)アリール基

【化5】



10

20

のうちの1つを表し { (ヘタ)アリールの場合、基Y又はZの一方のみが(ヘタ)アリールを表すことができる} ;

V¹ が、水素、フッ素、塩素、臭素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₂ - ハロアルキル、C₁ - C₂ - ハロアルコキシ、ニトロ、シアノを表すか、又は、フェニル {該フェニルは、フッ素、塩素、臭素、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₂ - ハロアルキル、C₁ - C₂ - ハロアルコキシ、ニトロ又はシアノで一置換又は二置換されていても良い} を表し、

V² 及び V³ が、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₂ - ハロアルキル又はC₁ - C₂ - ハロアルコキシを表し、

30

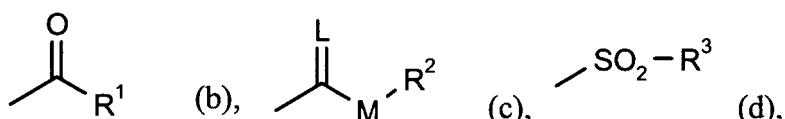
A及びBは、シクロヘキサン環の4'位の炭素原子と一緒にテトラヒドロフラン環を表し、その酸素原子は4'位の炭素原子に直接結合しており、

Dが、NH(1)又は酸素(2)を表し、

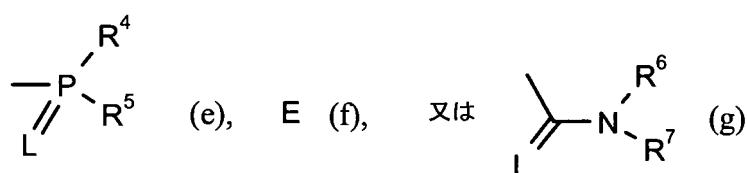
Q¹ 及び Q² が、互いに独立して、水素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ又はエトキシを表し、

Gが、水素(a)を表すか、又は、以下の基

【化6】



40



のうちの1つを表し、
ここで、

50

E が、金属イオン又はアンモニウムイオンを表し、

L が、酸素又は硫黄を表し、並びに

M が、酸素又は硫黄を表し、

R¹ が、C₁ - C₁₆ - アルキル、C₂ - C₁₆ - アルケニル、C₁ - C₆ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₆ - アルキルチオ - C₁ - C₄ - アルキル若しくはポリ - C₁ - C₆ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル { これらは、それぞれ、フッ素又は塩素で一置換から三置換されていても良い } を表すか、又は、C₃ - C₇ - シクロアルキル { 該シクロアルキルは、フッ素、塩素、C₁ - C₅ - アルキル又はC₁ - C₅ - アルコキシで一置換又は二置換されていても良く、また、1つ又は2つの直接には隣接していないメチレン基は酸素及び / 又は硫黄で置き換えられていても良い } を表し、

10

フェニル { 該フェニルは、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₃ - ハロアルキル、C₁ - C₃ - ハロアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ又はC₁ - C₄ - アルキルスルホニルで一置換から三置換されていても良い } を表し、

フェニル - C₁ - C₄ - アルキル { 該フェニル - C₁ - C₄ - アルキルは、フッ素、塩素、臭素、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₃ - ハロアルキル又はC₁ - C₃ - ハロアルコキシで一置換又は二置換されていても良い } を表し、

ピラゾリル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジル、フラニル又はチエニル { これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素又はC₁ - C₄ - アルキルで一置換又は二置換されていても良い } を表し、

20

フェノキシ - C₁ - C₅ - アルキル { 該フェノキシ - C₁ - C₅ - アルキルは、フッ素、塩素、臭素又はC₁ - C₄ - アルキルで一置換又は二置換されていても良い } を表し、又は、

ピリジルオキシ - C₁ - C₅ - アルキル、ピリミジルオキシ - C₁ - C₅ - アルキル又はチアゾリルオキシ - C₁ - C₅ - アルキル { これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、アミノ又はC₁ - C₄ - アルキルで一置換又は二置換されていても良い } を表し、

R² が、C₁ - C₁₆ - アルキル、C₂ - C₁₆ - アルケニル、C₁ - C₆ - アルコキシ - C₂ - C₆ - アルキル { これらは、それぞれ、フッ素又は塩素で一置換から三置換されていても良い } を表し、

C₃ - C₇ - シクロアルキル { 該シクロアルキルは、フッ素、塩素、C₁ - C₄ - アルキル又はC₁ - C₄ - アルコキシで一置換又は二置換されていても良い } を表し、又は、

30

フェニル又はベンジル { これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₃ - アルコキシ、C₁ - C₃ - ハロアルキル又はC₁ - C₃ - ハロアルコキシで一置換から三置換されていても良い } を表し、

R³ が、C₁ - C₆ - アルキル { 該アルキルは、フッ素又は塩素で一置換から三置換されていても良い } を表すか、又は、フェニル若しくはベンジル { これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₂ - ハロアルコキシ、C₁ - C₂ - ハロアルキル、シアノ又はニトロで一置換又は二置換されていても良い } を表し、

R⁴ 及び R⁵ が、互いに独立して、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₆ - アルキル) アミノ、C₁ - C₆ - アルキルチオ若しくはC₃ - C₄ - アルケニルチオ { これらは、それぞれ、フッ素又は塩素で一置換から三置換されていても良い } を表すか、又は、フェニル、フェノキシ若しくはフェニルチオ { これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、C₁ - C₃ - アルコキシ、C₁ - C₃ - ハロアルコキシ、C₁ - C₃ - アルキルチオ、C₁ - C₃ - ハロアルキルチオ、C₁ - C₃ - アルキル又はC₁ - C₃ - ハロアルキルで一置換又は二置換されていても良い } を表し、

40

R⁶ 及び R⁷ が、互いに独立して、水素を表し、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₃ - C₆ - アルケニル若しくはC₁ - C₆ - アルコキシ - C₂ - C₆ - アルキル { これらは、それぞれ、フッ素又は塩素で一置換か

50

ら三置換されていても良い}を表し、フェニル若しくはベンジル{これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、C₁ - C₅ - ハロアルキル、C₁ - C₅ - アルキル又はC₁ - C₅ - アルコキシで一置換から三置換されていても良い}を表すか、又は、一緒になって、C₁ - C₄ - アルキルで置換されていても良いC₃ - C₆ - アルキレン基{1つのメチレン基は、酸素又は硫黄で置き換えられていても良い}を表す、

請求項1に記載の式(I)の化合物。

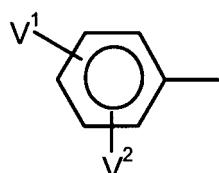
【請求項4】

Wが、水素、塩素、臭素、メチル、エチル、ビニル、エチニル、プロピニル、シクロブロピル、メトキシ、エトキシ又はトリフルオロメチルを表し、

Xが、塩素、臭素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ビニル、エチニル、プロピニル、シクロブロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ又はシアノを表し、
10

Y及びZが、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、ビニル、エチニル、プロピニル、シクロブロピル、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、シアノ又は、フェニル基

【化7】



20

を表し{フェニルの場合、基Y又はZの一方のみがフェニルを表すことができる}；

V¹が、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、tert-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル又はトリフルオロメトキシを表し、

V²が、水素、フッ素、塩素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ又はトリフルオロメチルを表し、

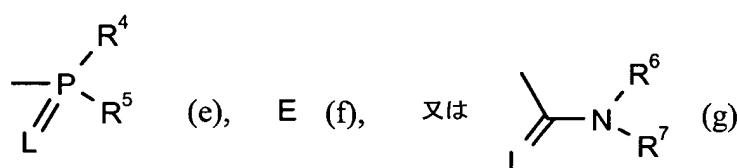
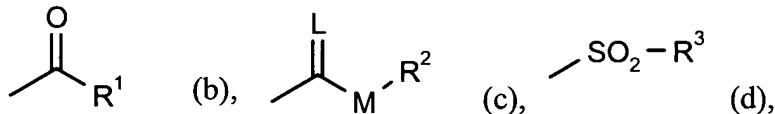
A及びBは、シクロヘキサン環の4'位の炭素原子と一緒にテトラヒドロフラン環を表し、その酸素原子は4'位の炭素原子に直接結合しており、
30

Dが、NH(1)又は酸素(2)を表し、

Q¹及びQ²が、水素を表し、

Gが、水素(a)を表すか、又は、以下の基

【化8】



40

のうちの1つを表し、

ここで、

Eが、金属イオン又はアンモニウムイオンを表し、

Lが、酸素又は硫黄を表し、並びに

Mが、酸素又は硫黄を表し、

50

R¹ が、C₁ - C₁₀ - アルキル、C₂ - C₁₀ - アルケニル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキルチオ - C₁ - C₂ - アルキル {これらは、それぞれ、フッ素又は塩素で一置換から三置換されていても良い} を表すか、又は、C₃ - C₆ - シクロアルキル {該シクロアルキルは、フッ素、塩素、メチル、エチル又はメトキシで一置換されていても良い} を表し、

フェニル {該フェニルは、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル又はトリフルオロメトキシで一置換又は二置換されていても良い} を表し、

フラニル、チエニル又はビリジル {これらは、それぞれ、塩素、臭素又はメチルで一置換されていても良い} を表し、

R² が、C₁ - C₁₀ - アルキル、C₂ - C₁₀ - アルケニ又はC₁ - C₄ - アルコキシ - C₂ - C₄ - アルキル {これらは、それぞれ、フッ素又は塩素で一置換から三置換されていても良い} を表し、

シクロペンチル又はシクロヘキシルを表し、

又は、

フェニル又はベンジル {これらは、それぞれ、フッ素、塩素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、メトキシ、トリフルオロメチル又はトリフルオロメトキシで一置換又は二置換されていても良い} を表し、

R³ が、メチル、エチル、プロピル若しくはイソプロピル {これらは、それぞれ、フッ素又は塩素で一置換から三置換されていても良い} を表すか、又は、フェニル {該フェニルは、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ又はニトロで一置換されていても良い} を表し、

R⁴ 及び R⁵ が、互いに独立して、C₁ - C₄ - アルコキシ若しくはC₁ - C₄ - アルキルチオを表すか、又は、フェニル、フェノキシ若しくはフェニルチオ {これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル又はトリフルオロメトキシで一置換されていても良い} を表し、

R⁶ 及び R⁷ が、互いに独立して、水素を表し、C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₃ - C₄ - アルケニル若しくはC₁ - C₄ - アルコキシ - C₂ - C₄ - アルキルを表し、フェニル {該フェニルは、フッ素、塩素、臭素、メチル、メトキシ又はトリフルオロメチルで一置換又は二置換されていても良い} を表すか、又は、一緒になって、C₅ - C₆ - アルキレン基 {1つのメチレン基は、酸素又は硫黄で置き換えられていても良い} を表す、

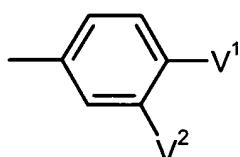
請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 5】

W が、水素、塩素、臭素、メチル、エチル又はメトキシを表し、

X が、塩素、臭素、メチル、エチル又はメトキシを表し、

Y 及び Z が、互いに独立して、水素、塩素、臭素若しくはメチルを表すか、又は、基【化 9】



を表し (この場合、基 Y 又は Z の一方のみが

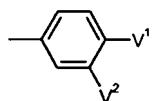
10

20

30

40

【化10】



を表すことができる) ;

V^1 が、フッ素又は塩素を表し、

V^2 が、水素、フッ素又は塩素を表し、

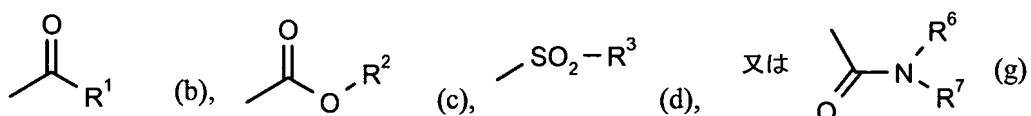
A 及び B とそれらが結合している炭素原子(4'位)が、テトラヒドロフラン環 {該テトラヒドロフラン環は、メチル、エチル、プロピル又はメトキシメチルで一置換されても良い} を表し、
10

D が、NH(1)又は酸素(2)を表し、

Q¹ 及び Q² が、水素を表し、

G が、水素(a)を表すか、又は、以下の基:

【化11】



20

のうちの1つを表し、

R¹ が、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₂-アルキル又はC₃-C₆-シクロアルキルを表し、

フェニル {該フェニルは、塩素で一置換されても良い} を表すか、又は、チエニルを表し、

R² が、C₁-C₁₀-アルキル、C₂-C₁₀-アルケニルを表すか、又は、ベンジルを表し、

R³ が、メチルを表し、

R⁶ 及び R⁷ が、一緒になって、C₅-C₆-アルキレン基 {1つのメチレン基は、酸素又は硫黄で置き換えられても良い} を表す、
30

請求項1に記載の式(I)の化合物。

【請求項6】

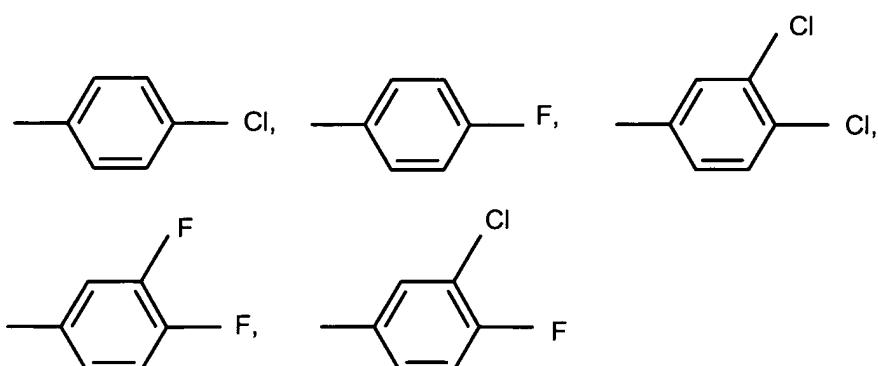
W が、水素、塩素、臭素、メチル又はエチルを表し、

X が、塩素、臭素、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ又はシクロプロピルを表し、

Y が、水素、メチル、エチル、塩素、臭素、ヨウ素、フッ素、トリフルオロメトキシ又はシクロプロピルを表し、

Z が、水素、臭素若しくはメチルを表すか、又は、基

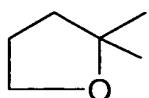
【化12】



40

を表し、
50

A 及び B とそれらが結合している炭素原子（4'位）が、
【化13】



を表し、

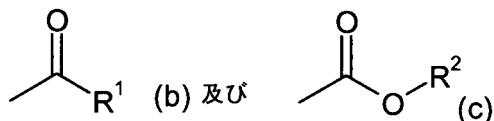
D が、NH(1)又は酸素(2)を表し、

Q¹及びQ²が、水素を表し、

G が、水素(a)を表すか、又は、以下の基：

10

【化14】



のうちの1つを表し、

R¹が、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₂-アルキル又はシクロプロピルを表し、

R²が、C₁-C₆-アルキル又はベンジルを表す、

20

請求項1に記載の式(I)の化合物。

【請求項7】

有害生物(pest)及び/又は望ましくない植生を防除するための組成物であって、請求項1に記載の式(I)の少なくとも1種類の化合物を含んでいることを特徴とする、前記組成物。

【請求項8】

動物有害生物(animal pest)及び/又は望ましくない植生を防除する方法であって、有害生物(pest)、望ましくない植生及び/又はそれらの生息環境に、請求項1に記載の式(I)の化合物を作用させることを特徴とする、前記方法。

【請求項9】

動物有害生物(animal pest)及び/又は望ましくない植生を防除するため、請求項1に記載の式(I)の化合物の使用。

30

【請求項10】

有害生物(pest)及び/又は望ましくない植生を防除するための組成物を調製する方法であって、請求項1に記載の式(I)の化合物を增量剤及び/又は界面活性剤と混合させることを特徴とする、前記方法。

【請求項11】

有害生物(pest)及び/又は望ましくない植生を防除するための組成物を調製するための、請求項1に記載の式(I)の化合物の使用。

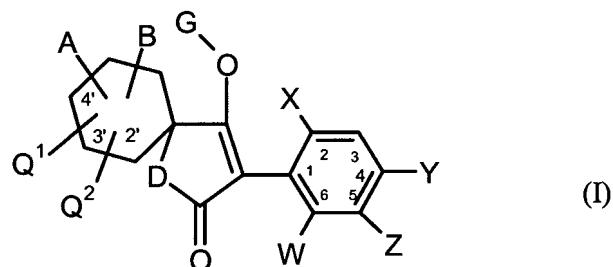
【請求項12】

有効量の活性化合物の組合せを含んでいる除草剤組成物であって、該組合せが、成分として、

(a') 式(I)

40

【化 15】



10

[式中、A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、請求項1において定義された通りである]の少なくとも1種類の化合物；

及び、

(b') 以下の化合物の群から選択される作物植物の適合性を改善する少なくとも1種類の化合物；

を含んでいる前記組成物：

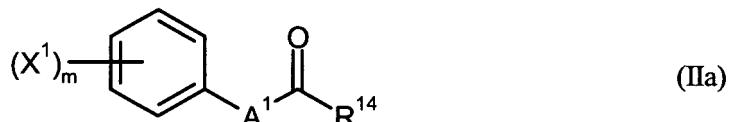
4 - ジクロロアセチル - 1 - オキサ - 4 - アザスピロ [4 . 5] デカン (A D - 6 7 , M
O N - 4 6 6 0)、1 - ジクロロアセチルヘキサヒドロ - 3 , 3 , 8 a - トリメチルピロ
ロ [1 , 2 - a] ピリミジン - 6 (2 H) - オン (ジシクロノン (dicyclonon) 、 B A S
- 1 4 5 1 3 8)、4 - ジクロロアセチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 3 - メチル - 2 H - 1 ,
4 - ベンゾオキサジン (ベノキサコール)、1 - メチルヘキシリル - 5 - クロロキノリン -
8 - オキシアセテート (クロキントセット - メキシリル)、3 - (2 - クロロベンジル) -
1 - (1 - メチル - 1 - フェニルエチル) 尿素 (クミルロン)、 - (シアノメトキシイ
ミノ) フェニルアセトニトリル (シオメトリニル (cyometriniil))、2 , 4 - ジクロロ
フェノキシ酢酸 (2 , 4 - D)、4 - (2 , 4 - ジクロロフェノキシ) 酢酸 (2 , 4 - D
B)、1 - (1 - メチル - 1 - フェニルエチル) - 3 - (4 - メチルフェニル) 尿素 (ダ
イムロン (daimuron , dymron))、3 , 6 - ジクロロ - 2 - メトキシ安息香酸 (ジカンバ
)、S - 1 - メチル - 1 - フェニルエチル ピペリジン - 1 - チオカルボキシレート (ジ
メピレート)、2 , 2 - ジクロロ - N - (2 - オキソ - 2 - (2 - プロペニルアミノ) エ
チル) - N - (2 - プロペニル) アセトアミド (D K A - 2 4)、2 , 2 - ジクロロ - N
, N - ジ - 2 - プロペニルアセトアミド (ジクロルミド)、4 , 6 - ジクロロ - 2 - フェ
ニルピリミジン (フエンクロリム)、1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - トリクロ
ロメチル - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - カルボン酸エチル (フエンクロラゾー
ル - エチル)、2 - クロロ - 4 - トリフルオロメチルチアゾール - 5 - カルボン酸フェニ
ルメチル (フルラゾール)、4 - クロロ - N - (1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イルメトキ
シ) - トリフォルオロアセトフェノンオキシム (フルキソフェニム)、3 - ジクロロア
セチル - 5 - (2 - フラニル) - 2 , 2 - ジメチルオキサゾリジン (フリラゾール、M O
N - 1 3 9 0 0)、4 , 5 - ジヒドロ - 5 , 5 - ジフェニル - 3 - イソオキサゾールカル
ボン酸エチル (イソキサジフェン - エチル)、1 - (エトキシカルボニル) エチル 3 ,
6 - ジクロロ - 2 - メトキシベンゾエート (ラクチジクロル)、(4 - クロロ - o - トリ
ルオキシ) 酢酸 (M C P A)、2 - (4 - クロロ - o - トリルオキシ) プロピオン酸 (メ
コプロップ)、1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 5 - メチル - 1
H - ピラゾール - 3 , 5 - ジカルボン酸ジエチル (メフェンピル - ジエチル)、2 - ジク
ロロメチル - 2 - メチル - 1 , 3 - ジオキソラン (M G - 1 9 1)、2 - プロペニル - 1
- オキサ - 4 - アザスピロ [4 . 5] デカン - 4 - カルボジチオエート (M G - 8 3 8)
、1 , 8 - ナフタル酸無水物、 - (1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イルメトキシイミノ)
フェニルアセトニトリル (オキサベトリニル)、2 , 2 - ジクロロ - N - (1 , 3 - ジオ
キソラン - 2 - イルメチル) - N - (2 - プロペニル) アセトアミド (P P G - 1 2 9 2
)、3 - ジクロロアセチル - 2 , 2 - ジメチルオキサゾリジン (R - 2 8 7 2 5)、3 -
40
45
50

ジクロロアセチル - 2 , 2 , 5 - トリメチルオキサゾリジン (R - 29148) 、 4 - (4 - クロロ - o - トリル) 酪酸、 4 - (4 - クロロフェノキシ) 酪酸、 ジフェニルメトキシ酢酸、 ジフェニルメトキシ酢酸メチル、 ジフェニルメトキシ酢酸エチル、 1 - (2 - クロロフェニル) - 5 - フェニル - 1H - ピラゾール - 3 - カルボン酸メチル、 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - メチル - 1H - ピラゾール - 3 - カルボン酸エチル、 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - 1H - ピラゾール - 3 - カルボン酸エチル、 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - フェニル - 1H - ピラゾール - 3 - カルボン酸エチル、 5 - (2 , 4 - ジクロロベンジル) - 2 - イソオキサゾリン - 3 - カルボン酸エチル、 5 - フェニル - 2 - イソオキサゾリン - 3 - カルボン酸エチル、 5 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - フェニル - 2 - イソオキサゾリン - 3 - カルボン酸エチル、 1 , 3 - ジメチルブト - 1 - イル 5 - クロロキノリン - 8 - オキシアセテート、 4 - アリルオキシブチル 5 - クロロキノリン - 8 - オキシアセテート、 メチル 5 - クロロキノキサリン - 8 - オキシアセテート、 エチル 5 - クロロキノリノン - 8 - オキシアセテート、 アリル 5 - クロロキノキサリン - 8 - オキシアセテート、 2 - オキソプロブ - 1 - イル 5 - クロロキノリン - 8 - オキシアセテート、 ジエチル 5 - クロロキノリン - 8 - オキシマロネート、 ジアリル 5 - クロロキノキサリン - 8 - オキシマロネート、 ジエチル 5 - クロロキノリン - 8 - オキシマロネート、 4 - カルボキシクロマン - 4 - イル酢酸 (AC - 304415) 、 4 - クロロフェノキシ酢酸、 3 , 3' - ジメチル - 4 - メトキシベンゾフェノン、 1 - ブロモ - 4 - クロロメチルスルホニルベンゼン、 1 - [4 - (N - 2 - メトキシベンゾイル) フェニル] - 3 - メチル尿素 (「 N - (2 - メトキシベンゾイル) - 4 - [(メチルアミノカルボニル) アミノ] ベンゼンスルホニアミド」としても知られている。) 、 1 - [4 - (N - 2 - メトキシベンゾイルスルファモイル) フェニル] - 3 , 3 - ジメチル尿素、 1 - [4 - (N - 4 , 5 - ジメチルベンゾイルスルファモイル) フェニル] - 3 , 3 - メチル尿素、 1 - [4 - (N - ナフチルスルファモイル) フェニル] - 3 , 3 - ジメチル尿素、 N - (2 - メトキシ - 5 - メチルベンゾイル) - 4 - (シクロプロピルアミノカルボニル) ベンゼンスルホニアミド、

及び / 又は、一般式で定義されている以下の化合物のうちの 1 種類 :

一般式 (IIa)

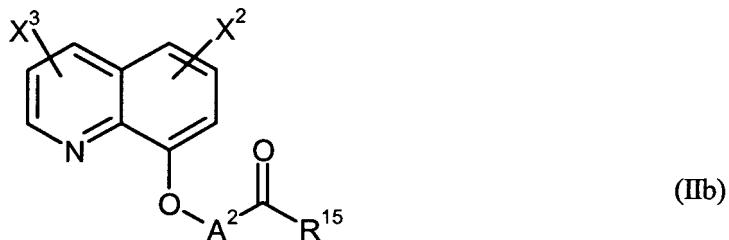
【化 16】



の化合物、若しくは、

一般式 (IIb)

【化 17】



の化合物、若しくは、

一般式 (IIc)

10

20

30

40

50

【化18】



の化合物

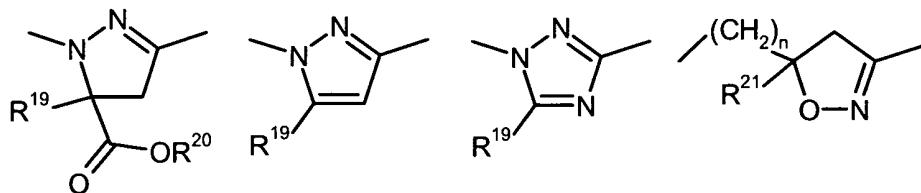
[上記式中、

mは、数0、1、2、3、4又は5を表し、

A¹は、以下に示されている二価ヘテロ環式基

10

【化19】



のうちの1つを表し、

nは、数0、1、2、3、4又は5を表し、

20

A²は、C₁-C₄-アルキル及び/又はC₁-C₄-アルコキシ-カルボニル及び/又はC₁-C₄-アルケニルオキシカルボニルで置換されていても良い1個又は2個の炭素原子を有するアルカンジイルを表し、R¹⁻⁴は、ヒドロキシル、メルカプト、アミノ、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-アルキルアミノ又はジ(C₁-C₄-アルキル)アミノを表し、R¹⁻⁵は、ヒドロキシル、メルカプト、アミノ、C₁-C₇-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-アルケニルオキシ、C₁-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルアミノ又はジ(C₁-C₄-アルキル)アミノを表し、

30

R¹⁻⁶は、フッ素、塩素及び/又は臭素で置換されていても良いC₁-C₄-アルキルを表し、R¹⁻⁷は、水素を表し、それぞれフッ素、塩素及び/若しくは臭素で置換されていても良いC₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル若しくはC₂-C₆-アルキニル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、ジオキソラニル-C₁-C₄-アルキル、フリル、フリル-C₁-C₄-アルキル、チエニル、チアゾリル、ピペリジニル、又は、フッ素、塩素及び/若しくは臭素若しくはC₁-C₄-アルキルで置換されていても良いフェニルを表し、R¹⁻⁸は、水素を表し、それぞれフッ素、塩素及び/若しくは臭素で置換されていても良いC₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル若しくはC₂-C₆-アルキニル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、ジオキソラニル-C₁-C₄-アルキル、フリル、フリル-C₁-C₄-アルキル、チエニル、チアゾリル、ピペリジニル、又は、フッ素、塩素及び/若しくは臭素若しくはC₁-C₄-アルキルで置換されていても良いフェニルを表し、R¹⁻⁷とR¹⁻⁸は、さらにまた、一緒にになって、C₃-C₆-アルカンジイル又はC₂-C₅-オキサアルカンジイル{これらは、それぞれ、C₁-C₄-アルキル、フェニル、フリル若しくは縮合ベンゼン環で置換されていても良いか、又は、2つの置換基で置換されていても良く、その際、該2つの置換基は、それらが結合しているC原子と一緒に5員又は6員の炭素環を形成している}も表し、

40

R¹⁻⁹は、水素、シアノ若しくはハロゲンを表すか、又は、それぞれフッ素、塩素及び/若しくは臭素で置換されていても良いC₁-C₄-アルキル、C₃-C₆-シクロアル

50

キル若しくはフェニルを表し、

R^{20} は、水素、それぞれヒドロキシル、シアノ、ハロゲン若しくは $C_1 - C_4$ - アルコキシで置換されていても良い $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル若しくはトリ - ($C_1 - C_4$ - アルキル)シリルを表し、

R^{21} は、水素、シアノ若しくはハロゲンを表すか、又は、それぞれフッ素、塩素及び / 若しくは臭素で置換されていても良い $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル若しくはフェニルを表し、

X^1 は、ニトロ、シアノ、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ又は $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシを表し、

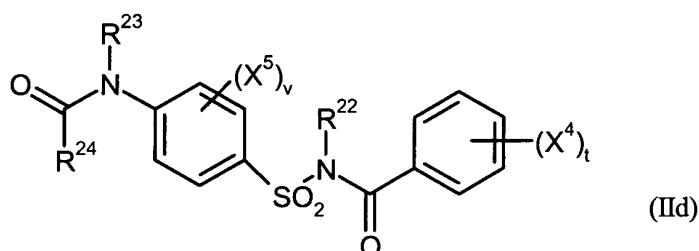
X^2 は、水素、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ又は $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシを表し、

X^3 は、水素、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ又は $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシを表す]、

及び / 又は、一般式で定義されている以下の化合物：

一般式 (IIId)

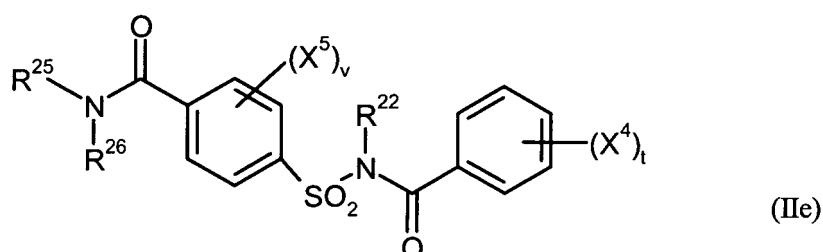
【化20】



の化合物、若しくは、

一般式 (IIie)

【化21】



の化合物

[上記式中、

t は、数 0、1、2、3、4 又は 5 を表し、

v は、数 0、1、2、3、4 又は 5 を表し、

R^{22} は、水素又は $C_1 - C_4$ - アルキルを表し、

R^{23} は、水素又は $C_1 - C_4$ - アルキルを表し、

R^{24} は、水素、それぞれシアノ、ハロゲン若しくは $C_1 - C_4$ - アルコキシで置換されていても良い $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ若しくはジ ($C_1 - C_4$ - アルキル)アミノ、又は、それぞれシアノ、ハロゲン若しくは $C_1 - C_4$ - アルキルで置換されていても良い $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルオキシ、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルチオ若しくは $C_3 - C_6$ - シクロアルキルアミノを表し、

R^{25} は、水素、シアノ、ヒドロキシル、ハロゲン若しくは $C_1 - C_4$ - アルコキシで置換されていても良い $C_1 - C_6$ - アルキル、それぞれシアノ若しくはハロゲンで置換されていても良い $C_3 - C_6$ - アルケニル若しくは $C_3 - C_6$ - アルキニル、又は、シアノ

40

50

、ハロゲン若しくはC₁ - C₄ - アルキルで置換されていても良いC₃ - C₆ - シクロアルキルを表し、

R²は、水素、シアノ、ヒドロキシル、ハロゲン若しくはC₁ - C₄ - アルコキシで置換されていても良いC₁ - C₆ - アルキル、それぞれシアノ若しくはハロゲンで置換されていても良いC₃ - C₆ - アルケニル若しくはC₃ - C₆ - アルキニル、シアノ、ハロゲン若しくはC₁ - C₄ - アルキルで置換されていても良いC₃ - C₆ - シクロアルキル、又は、ニトロ、シアノ、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ若しくはC₁ - C₄ - ハロアルコキシで置換されていても良いフェニルを表すか、又は、R²と一緒になって、それぞれC₁ - C₄ - アルキルで置換されていても良いC₂ - C₆ - アルカンジイル若しくはC₂ - C₅ - オキサアルカンジイルを表し、

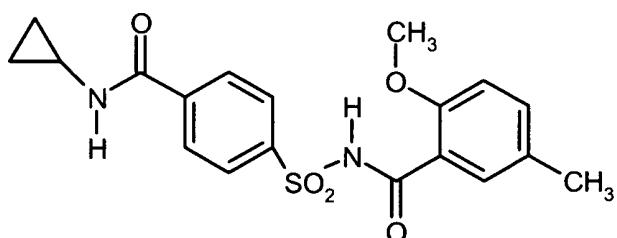
X⁴は、ニトロ、シアノ、カルボキシル、カルバモイル、ホルミル、スルファモイル、ヒドロキシル、アミノ、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ又はC₁ - C₄ - ハロアルコキシを表し、及び、

X⁵は、ニトロ、シアノ、カルボキシル、カルバモイル、ホルミル、スルファモイル、ヒドロキシル、アミノ、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ又はC₁ - C₄ - ハロアルコキシを表す】。

【請求項13】

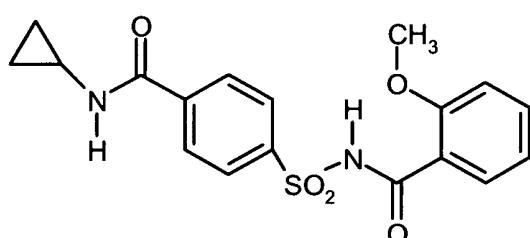
作物植物の適合性を改善する前記化合物が、以下の化合物の群：
クロキントセット - メキシル、フェンクロラゾール - エチル、イソキサジフェン - エチル
、メフェンピル - ジエチル、フリラゾール、フェンクロリム、クミルロン、ダイムロン、
又は、化合物

【化22】



10

及び



30

から選択されることを特徴とする、請求項12に記載の組成物。

【請求項14】

作物植物の適合性を改善する前記化合物が、クロキントセット - メキシルであることを特徴とする、請求項12又は13に記載の組成物。

【請求項15】

作物植物の適合性を改善する前記化合物が、メフェンピル - ジエチルであることを特徴とする、請求項12又は13に記載の組成物。

【請求項16】

望ましくない植生を防除する方法であって、該植物又はそれらの生息環境に、請求項12に記載の組成物を作用させることを特徴とする、前記方法。

【請求項17】

望ましくない植生を防除するための、請求項12に記載の組成物の使用。

40

50

【請求項 18】

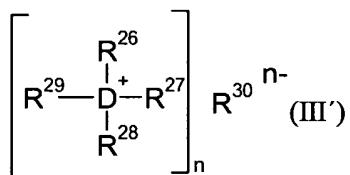
望ましくない植生を防除する方法であって、該植物又はそれらの生息環境に、請求項1に記載の式(Ⅰ)の化合物及び請求項12に記載の作物植物の適合性を改善する化合物を、短時間の間に続けて別々に作用させることを特徴とする、前記方法。

【請求項 19】

殺有害生物剤及び除草剤組成物であって、

- ・ 請求項1に記載の式(Ⅰ)の少なくとも1種類の化合物又は請求項12に記載の組成物；
及び、
・ 式(Ⅲ')

【化23】



[式中、

Dは、窒素又はリンを表し、

R^{26} 、 R^{27} 、 R^{28} 及び R^{30} は、互いに独立して、水素、又は、それぞれ置換されていても良い $C_1 - C_8$ -アルキル又はモノ不飽和若しくはポリ不飽和の置換されても良い $C_1 - C_8$ -アルキレン〔該置換基は、ハロゲン、ニトロ及びシアノからなる群から選択され得る〕を表し、

n は、1、2、3又は4を表し、

R^{30} は、無機アニオン又は有機アニオンを表す]
の少なくとも1種類の塩；

を含んでいる、前記組成物。

【請求項 20】

少なくとも1種類の浸透剤を含んでいることを特徴とする、請求項19に記載の組成物。

【請求項 21】

請求項1に記載の式(Ⅰ)の活性化合物又は請求項12に記載の組成物を含んでいる殺有害生物剤及び/又は除草剤の活性を増大させる方法であって、請求項19に記載の式(Ⅲ')の塩を用いて即時使用可能な組成物(散布液)を調製することを特徴とする、前記方法。

【請求項 22】

浸透剤を用いて前記散布液を調製することを特徴とする、請求項21に記載の方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規オキサスピロ環式スピロ置換テトラミン酸及びテトロン酸誘導体、それを調製するための複数の方法、並びに、殺有害生物剤(pesticide)及び/又は除草剤としてのそれらの使用に関する。本発明は、さらにまた、選択的除草剤組成物も提供し、ここで、該除草剤組成物は、第1に、オキサスピロ環式スピロ置換テトラミン酸及びテトロン酸誘導体を含有し、第2に、作物植物の適合性を改善する化合物を含有している。

【0002】

本発明は、さらに、アンモニウム塩又はホスホニウム塩を添加することにより(及び、必要に応じて浸透剤も添加することにより)作物保護組成物(特に、オキサスピロ環式スピロ置換テトラミン酸及びテトロン酸誘導体を含んでいる作物保護組成物)の作用を増強

10

20

30

40

50

すること、対応するその組成物、それらの調製方法、並びに、殺虫剤及び／若しくは殺ダニ剤としての作物保護におけるそれらの適用並びに／又は望ましくない植物の生長を防止するためのそれらの適用にも関する。

【背景技術】

【0 0 0 3】

3 - アシルピロリジン - 2 , 4 - ジオン類に関しては、医薬的特性が既に記述されている (S. Suzuki et al. Chem. Pharm. Bull. 15 1120 (1967))。さらに、N - フェニルピロリジン - 2 , 4 - ジオン類は、R. Schmierer 及び H. Mildenberger によって合成された (Liebigs Ann. Chem. 1985, 1095)。これらの化合物の生物学的な活性については、これまで記述されていない。

10

【0 0 0 4】

EP-A-0262399 及び GB-A-2266888 には、類似した構造を有する化合物 (3 - アリールピロリジン - 2 , 4 - ジオン類) が開示されている。しかしながら、それら化合物に関して、除草作用、殺虫作用又は殺ダニ作用は、開示されていない。非置換二環式 3 - アリールピロリジン - 2 , 4 - ジオン誘導体 (EP-A-355599、EP-A-415211 及び JP-A-12-053670) は、除草作用、殺虫作用又は殺ダニ作用を有する既知化合物であり、また、置換单環式 3 - アリールピロリジン - 2 , 4 - ジオン誘導体 (EP-A-377893 及び EP-A-442077) も、除草作用、殺虫作用又は殺ダニ作用を有する既知化合物である。

【0 0 0 5】

さらに、以下のものも知られている：多環式 3 - アリールピロリジン - 2 , 4 - ジオン誘導体 (EP-A-442073)、及び、1 H - アリールピロリジンジオン誘導体 (EP-A-456063、EP-A-521334、EP-A-596298、EP-A-613884、EP-A-613885、WO 94/01997、WO 95/26954、WO 95/20572、EP-A-0668267、WO 96/25395、WO 96/35664、WO 97/01535、WO 97/02243、WO 97/36868、WO 97/43275、WO 98/05638、WO 98/06721、WO 98/25928、WO 99/24437、WO 99/43649、WO 99/48869、WO 99/55673、WO 01/17972、WO 01/23354、WO 01/74770、WO 03/013249、WO 03/062244、WO 2004/007448、WO 2004/024688、WO 04/065366、WO 04/080962、WO 04/111042、WO 05/044791、WO 05/044796、WO 05/048710、WO 05/049596、WO 05/066125、WO 05/092897、WO 06/000355、WO 06/029799、WO 06/056281、WO 06/056282、WO 06/089633、WO 07/048545、DEA 102005059892、WO 07/073856、WO 07/096058、WO 07/121868、WO 07/140881、DEA 102006007882、DEA 102006050148、DEA 102006057036 及び DEA 102006057037)。さらに、ケタール - 置換 1 H - アリールピロリジン - 2 , 4 - ジオン類は、WO 99/16748 によって知られており、(スピロ) - ケタール - 置換 N - アルコキシアアルコキシ - 置換アリールピロリジンジオン類は、JP-A-14205984 及び「Ito M. et al., Bioscience, Biotechnology and Biochemistry 67, 1230-1238, (2003)」によって知られている。ケトエノール類に葉害軽減剤を添加することも、原則として、WO 03/013249 によって知られている。さらに、WO 06/024411 には、ケトエノールを含んでいる除草剤組成物が開示されている。

20

【0 0 0 6】

特定の ³ - ジヒドロフラン - 2 - オン誘導体が除草特性、殺虫特性又は殺ダニ特性を有していることは知られている：EP-A-528156、EP-A-647637、WO 95/26954、WO 96/20196、WO 96/25395、WO 96/35664、WO 97/01535、WO 97/02243、WO 97/36868、WO 98/05638、WO 98/06721、WO 99/16748、WO 98/25928、WO 99/43649、WO 99/48869、WO 99/55673、WO 01/23354、WO 01/74770、WO 01/17972、WO 04/024688、WO 04/080962、WO 04/111042、WO 05/092897、WO 06/000355、WO 06/029799、WO 07/048545、WO 07/073856、WO 07/096058、DEA 102006057036、DEA 102007001866。

40

【先行技術文献】

【特許文献】

【0 0 0 7】

【特許文献 1】 欧州特許出願公開第0262399号

【特許文献 2】 英国特許出願公開第2266888号

50

【特許文献 3】欧州特許出願公開第355599号	
【特許文献 4】欧州特許出願公開第415211号	
【特許文献 5】特開平12-053670号	
【特許文献 6】欧州特許出願公開第377893号	
【特許文献 7】欧州特許出願公開第442077号	
【特許文献 8】欧州特許出願公開第442073号	
【特許文献 9】欧州特許出願公開第456063号	
【特許文献 10】欧州特許出願公開第521334号	
【特許文献 11】欧州特許出願公開第596298号	10
【特許文献 12】欧州特許出願公開第613884号	
【特許文献 13】欧州特許出願公開第613885号	
【特許文献 14】国際公開第94/01997号	
【特許文献 15】国際公開第95/26954号	
【特許文献 16】国際公開第95/20572号	
【特許文献 17】欧州特許出願公開第0668267号	
【特許文献 18】国際公開第96/25395号	
【特許文献 19】国際公開第96/35664号	20
【特許文献 20】国際公開第97/01535号	
【特許文献 21】国際公開第97/02243号	
【特許文献 22】国際公開第97/36868号	
【特許文献 23】国際公開第97/43275号	
【特許文献 24】国際公開第98/05638号	
【特許文献 25】国際公開第98/06721号	
【特許文献 26】国際公開第98/25928号	
【特許文献 27】国際公開第99/24437号	
【特許文献 28】国際公開第99/43649号	
【特許文献 29】国際公開第99/48869号	
【特許文献 30】国際公開第99/55673号	
【特許文献 31】国際公開第01/17972号	
【特許文献 32】国際公開第01/23354号	30
【特許文献 33】国際公開第01/74770号	
【特許文献 34】国際公開第03/013249号	
【特許文献 35】国際公開第03/062244号	
【特許文献 36】国際公開第2004/007448号	
【特許文献 37】国際公開第2004/024688号	
【特許文献 38】国際公開第04/065366号	
【特許文献 39】国際公開第04/080962号	
【特許文献 40】国際公開第04/111042号	
【特許文献 41】国際公開第05/044791号	
【特許文献 42】国際公開第05/044796号	40
【特許文献 43】国際公開第05/048710号	
【特許文献 44】国際公開第05/049596号	
【特許文献 45】国際公開第05/066125号	
【特許文献 46】国際公開第05/092897号	
【特許文献 47】国際公開第06/000355号	
【特許文献 48】国際公開第06/029799号	
【特許文献 49】国際公開第06/056281号	
【特許文献 50】国際公開第06/056282号	
【特許文献 51】国際公開第06/089633号	
【特許文献 52】国際公開第07/048545号	50

【特許文献 5 3】独国特許出願公開第102005059892号
 【特許文献 5 4】国際公開第07/073856号
 【特許文献 5 5】国際公開第07/096058号
 【特許文献 5 6】国際公開第07/121868号
 【特許文献 5 7】国際公開第07/140881号
 【特許文献 5 8】独国特許出願公開第102006007882号
 【特許文献 5 9】独国特許出願公開第102006050148号
 【特許文献 6 0】独国特許出願公開第102006057036号
 【特許文献 6 1】独国特許出願公開第102006057037号
 【特許文献 6 2】国際公開第99/16748号
 【特許文献 6 3】特開平14-205984号
 【特許文献 6 4】国際公開第06/024411号
 【特許文献 6 5】欧州特許出願公開第528156号
 【特許文献 6 6】欧州特許出願公開第6476376号
 【特許文献 6 7】国際公開第96/20196号
 【特許文献 6 8】独国特許出願公開第10200700186号

【非特許文献】

【0 0 0 8】

【非特許文献 1】S. Suzuki et al. Chem. Pharm. Bull. 15 1120 (1967)
 【非特許文献 2】Liebigs Ann. Chem. 1985, 1095

【非特許文献 3】Ito M. et al., Bioscience, Biotechnology and Biochemistry 67, 12 30-1238, (2003)

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0 0 0 9】

しかしながら、特に作物植物に関して、上記既知化合物の除草活性及び／若しくは殺ダニ活性及び／若しくは殺虫活性、並びに／又は、活性スペクトル、並びに／又は、植物の適合性は、必ずしも満足のいくものではない。

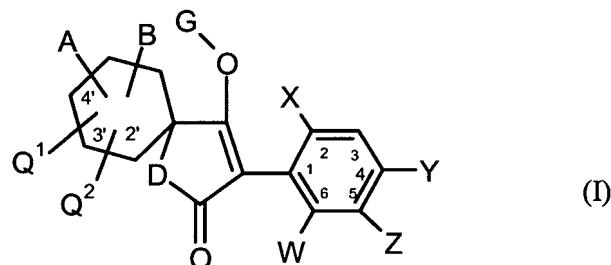
【課題を解決するための手段】

【0 0 1 0】

本発明は、式 (I)

【0 0 1 1】

【化 1】



〔式中、

Wは、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、置換されていてよいシクロアルキル、ハロゲン、アルコキシ、アルケニルオキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ又はシアノを表し、

Xは、ハロゲン、アルキル、アルケニル、アルキニル、置換されていてよいシクロアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルケニルオキシ、ニトロ又はシアノを表し、

10

20

30

40

50

Y及びZは、互いに独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、アルコキシ、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、シアノ若しくはニトロを表すか、又は、それぞれ置換されていてもよいアリール若しくはヘタリールを表し、

A及びBとそれらが結合している炭素原子は、テトラヒドロフラン環又はテトラヒドロピラン環（これらは、それぞれ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル又は置換されていてもよいフェニルで置換されていてもよい。）を表し、

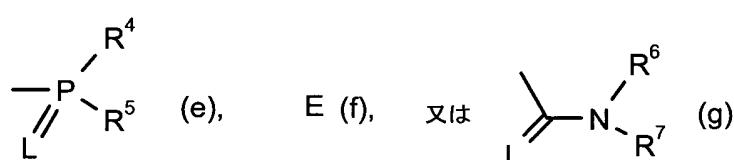
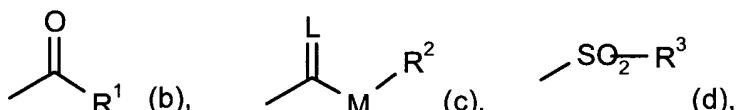
Dは、N H又は酸素を表し、

Q¹、Q²は、互いに独立して、水素、アルキル、ハロアルキル又はアルコキシを表し

Gは、水素（a）を表すか、又は、以下の基

【0012】

【化2】



のうちの1つを表し、

ここで、

Eは、金属イオン又はアンモニウムイオンを表し、

Lは、酸素又は硫黄を表し、

Mは、酸素又は硫黄を表し、

R¹は、それぞれハロゲン若しくはシアノで置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル若しくはポリアルコキシアルキルを表すか、又は、それぞれハロゲン、アルキル若しくはアルコキシで置換されていてもよいシクロアルキル若しくはヘテロシクリルを表すか、又は、それぞれ置換されていてもよいフェニル、フェニルアルキル、ヘタリール、フェノキシアルキル若しくはヘタリールオキシアルキルを表し、

R²は、それぞれハロゲン若しくはシアノで置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルコキシアルキル若しくはポarialコキシアルキルを表すか、又は、それぞれ置換されていてもよいシクロアルキル、フェニル若しくはベンジルを表し、

R³、R⁴及びR⁵は、互いに独立して、それぞれハロゲンで置換されてもよいアルキル、アルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルチオ、アルケニルチオ若しくはシクロアルキルチオを表すか、又は、それぞれ置換されていてもよいフェニル、ベンジル、フェノキシ若しくはフェニルチオを表し、

R⁶及びR⁷は、互いに独立して、水素を表すか、又は、それぞれハロゲン若しくはシアノで置換されていてもよいアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルコキシ若しくはアルコキシアルキルを表すか、又は、それぞれ置換されていてもよいフェニル若しくはベンジルを表すか、又は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、置換されていてもよい環（該環は、酸素又は硫黄を含んでいてもよい。）を形成している。）の新規化合物を提供する。

【0013】

とりわけ、置換基の種類に応じて、式（I）の化合物は、光学異性体として存在し得るか、又は、さまざまな組成の異性体混合物として存在し得る。この異性体混合物は、適切

10

20

30

40

50

な場合には、慣習的な方法で分離させることができる。本発明は、純粋な異性体と異性体混合物の両方を提供し、また、それらの調製及び使用、並びに、それらを含んでいる組成物も提供する。しかしながら、簡単にすることを目的として、以下の記載では、式(I)の化合物についてのみ言及するが、それは、純粋な化合物と、適切な場合には、さまざまな比率の異性体化合物を有する混合物の両方を意味している。

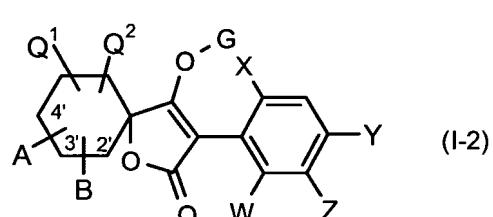
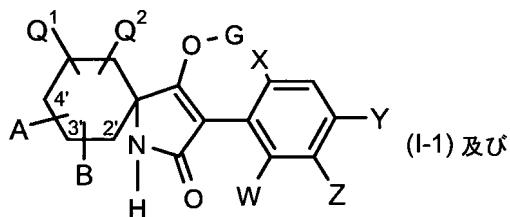
【0014】

DとしてのNH(1)及びDとしてのO(2)を組み入れることにより、以下の主要な構造(I-1)から構造(I-2)が得られる：

【0015】

【化3】

10



ここで、A、B、G、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。

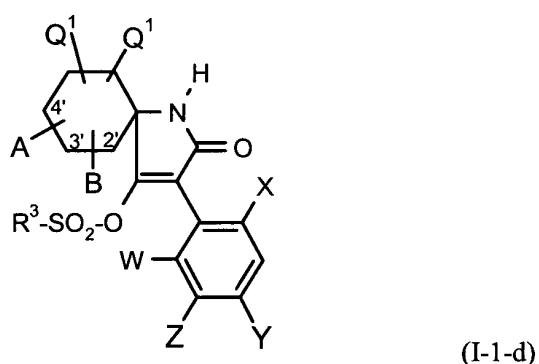
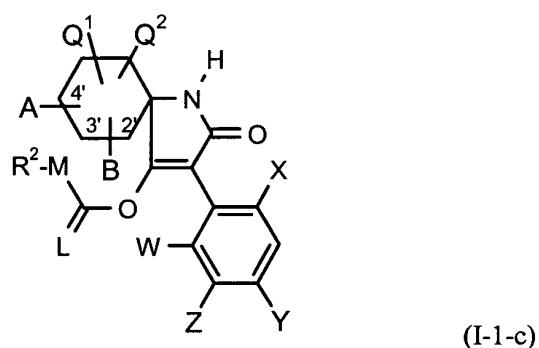
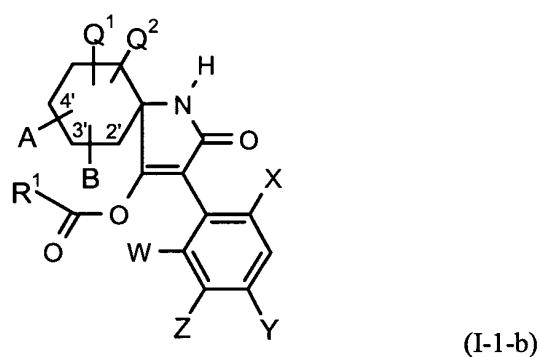
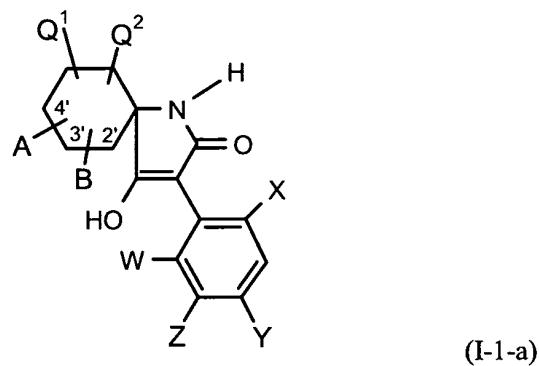
20

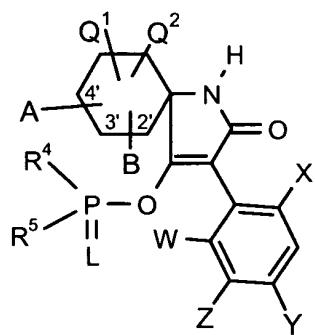
【0016】

Gについての種々の意味(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)及び(g)を組み入れることにより、DがNH(1)を表す場合、以下の主要な構造(I-1-a)から構造(I-1-g)が得られる：

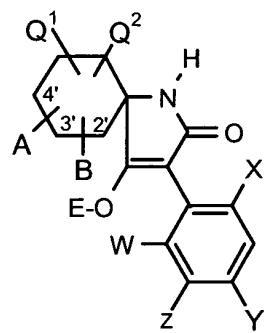
【0017】

【化4】

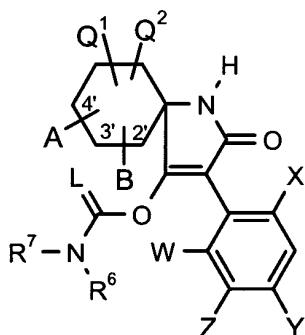




10



20



30

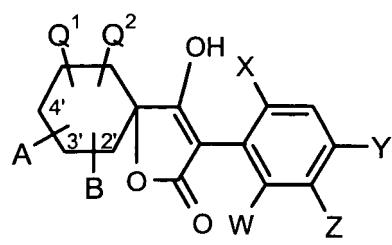
ここで、A、B、E、L、M、Q¹、Q²、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びR⁷は、上記で与えられている意味を有する。

【0018】

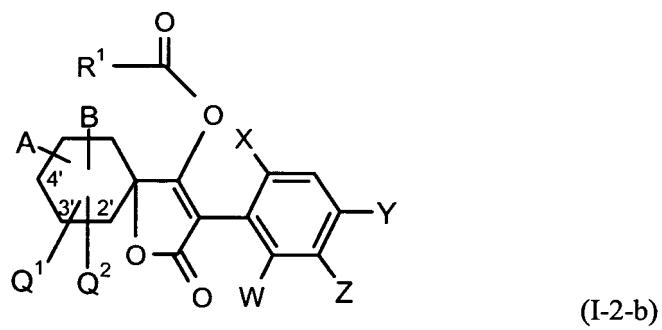
Gについての種々の意味(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)及び(g)を組み入れることにより、DがO(2)を表す場合、以下の主要な構造(I-2-a)から構造(I-2-g)が得られる：

【0019】

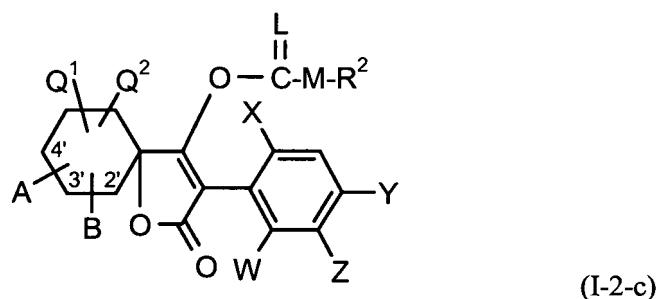
【化5】



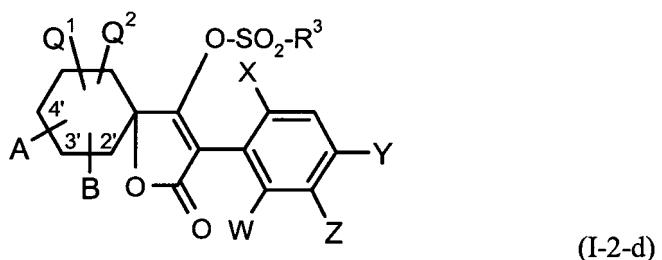
40



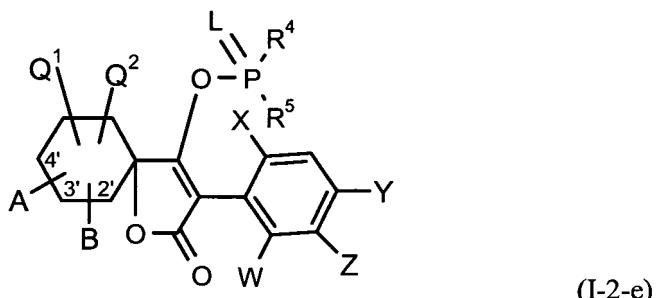
10



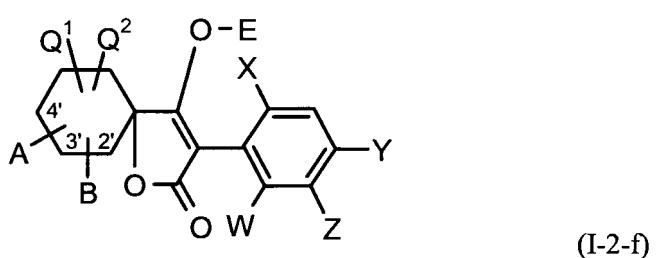
20

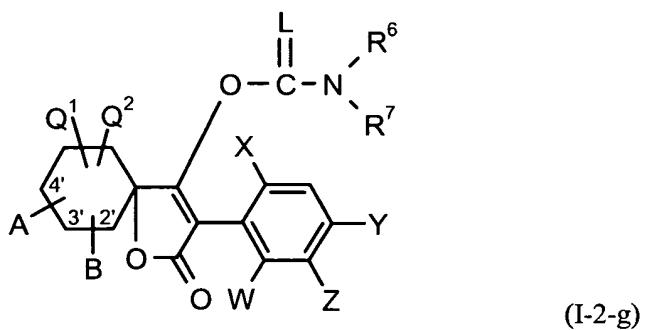


30



40





10

ここで、A、B、E、L、M、Q¹、Q²、W、X、Y、Z、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びR⁷は、上記で与えられている意味を有する。

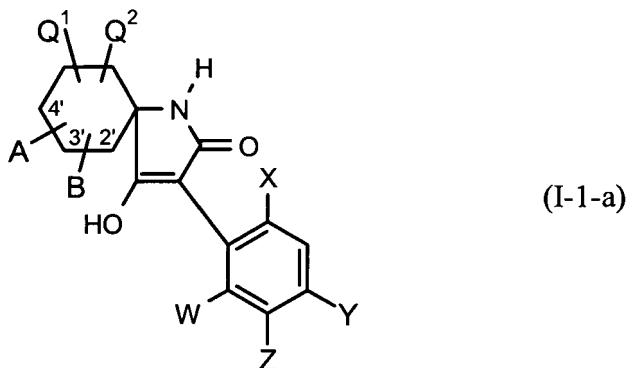
【0020】

さらに、式(I)の新規化合物が、下記調製方法のうちの1つによって得られるということが見いだされた：

(A) 式(I-1-a)

【0021】

【化6】



20

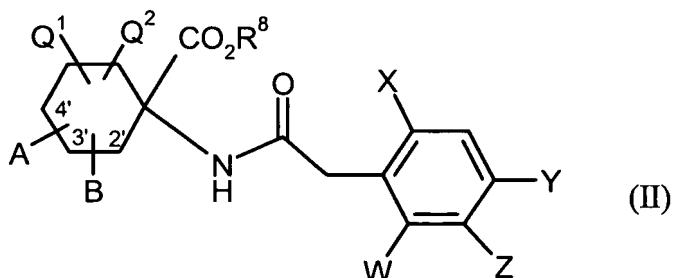
[式中、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。]

30

の化合物は、希釀剤の存在下及び塩基の存在下で、式(II)

【0022】

【化7】



40

[式中、

A、B、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有し；及び、R⁸は、アルキル（好ましくは、C₁-C₆-アルキル）を表す。]

の化合物を分子内縮合させれば得られる。

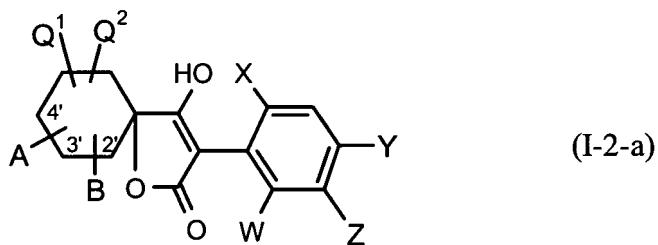
【0023】

(B) さらに、式(I-2-a)

【0024】

50

【化 8】

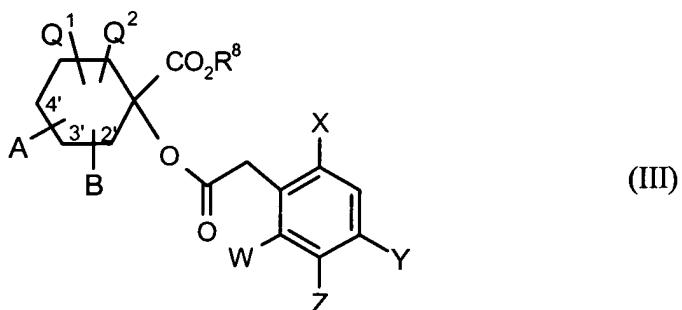


[式中、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。]

の化合物は、希釈剤の存在下及び塩基の存在下で、式(I-II)

【0025】

【化 9】



10

20

[式中、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z及びR⁸は、上記で与えられている意味を有する。]

の化合物を分子内縮合させれば得られるということも見いだされた。

【0026】

さらに、以下のことも見いだされた：

(C) 上記で示されている式(I-1-b)から式(I-2-b) [式中、R¹、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。] の化合物は、上記で示されている式(I-1-a)から式(I-2-a) [式中、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。] の化合物を、それぞれ、適切な場合には希釈剤の存在下、及び、適切な場合には酸結合剤の存在下で、

() 式(I-V)

【0027】

【化 10】



30

40

[式中、

R¹は、上記で与えられている意味を有し；及び、

Halは、ハロゲン（特に、塩素又は臭素）を表す。]

の化合物と反応させるか；

又は、

() 式(V)

【0028】

【化11】



[式中、R¹は、上記で与えられている意味を有する。]

のカルボン酸無水物と反応させれば、得られる；

(D) 上記で示されている式(I-1-c)から式(I-2-c) [式中、R²、A、B、Q¹、Q²、M、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有し、Lは酸素を表す。]の化合物は、上記で示されている式(I-1-a)から式(I-2-a) [式中、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。]の化合物を、それぞれ、適切な場合には希釈剤の存在下、及び、適切な場合には酸結合剤の存在下で、式(VI)

【0029】

【化12】



[式中、R²及びMは、上記で与えられている意味を有する。]

のクロロギ酸エステル又はクロロギ酸チオエステルと反応させれば得られる；

(E) 上記で示されている式(I-1-c)から式(I-2-c) [式中、R²、A、B、Q¹、Q²、M、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有し、Lは硫黄を表す。]の化合物は、上記で示されている式(I-1-a)から式(I-2-a) [式中、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。]の化合物を、それぞれ、適切な場合には希釈剤の存在下、及び、適切な場合には酸結合剤の存在下で、式(VII)

【0030】

【化13】



30

[式中、M及びR²は、上記で与えられている意味を有する。]

のクロロモノチオギ酸エステル又はクロロジチオギ酸エステルと反応させれば得られる；

(F) 上記で示されている式(I-1-d)から式(I-2-d) [式中、R³、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。]の化合物は、上記で示されている式(I-1-a)から式(I-2-a) [式中、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。]の化合物を、それぞれ、適切な場合には希釈剤の存在下、及び、適切な場合には酸結合剤の存在下で、式(VIII)

【0031】

【化14】



40

[式中、R³は上記で与えられている意味を有する。]

の塩化スルホニルと反応させれば得られる；

(G) 上記で示されている式(I-1-e)から式(I-2-e) [式中、L、R⁴、R⁵、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。]の化合物は、上記で示されている式(I-1-a)から式(I-2-a) [式中、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。]の化合

50

物を、それぞれ、適切な場合には希釈剤の存在下、及び、適切な場合には酸結合剤の存在下で、式(IX)

【0032】

【化15】



[式中、

L 、 R^4 及び R^5 は、上記で与えられている意味を有し；及び、

Hal は、ハロゲン（特に、塩素又は臭素）を表す。]

のリン化合物と反応させれば得られる；

(H) 上記で示されている式(I-1-f)から式(I-2-f) [式中、E、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。] の化合物は、式(I-1-a)から式(I-2-a) [式中、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。] の化合物を、それぞれ、適切な場合には希釈剤の存在下で、それぞれ、式(X)又は式(XI)

【0033】

【化16】



[式中、

Me は、1価又は2価の金属（好ましくは、アルカリ金属又はアルカリ土類金属、例えば、リチウム、ナトリウム、カリウム、マグネシウム又はカルシウム）を表し、

t は、数1又は2を表し、

R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} は、互いに独立して、水素又はアルキル（好ましくは、C₁-C₈-アルキル）を表す。]

の金属化合物又はアミンと反応させれば得られる；

(I) 上記で示されている式(I-1-g)から式(I-2-g) [式中、L、R⁶、R⁷、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。] の化合物は、上記で示されている式(I-1-a)から式(I-2-a) [式中、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。] の化合物を、それぞれに、

() 適切な場合には希釈剤の存在下、及び、適切な場合には触媒の存在下で、式(XII)

【0034】

【化17】



[式中、R⁶ 及び L は、上記で与えられている意味を有する。]

のイソシアネート又はイソチオシアネートと反応させるか；

又は、

() 適切な場合には希釈剤の存在下、及び、適切な場合には酸結合剤の存在下で、式(XIII)

10

20

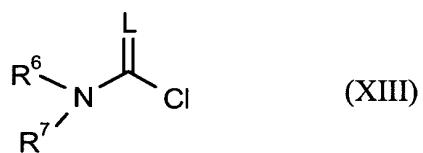
30

40

50

【0035】

【化18】



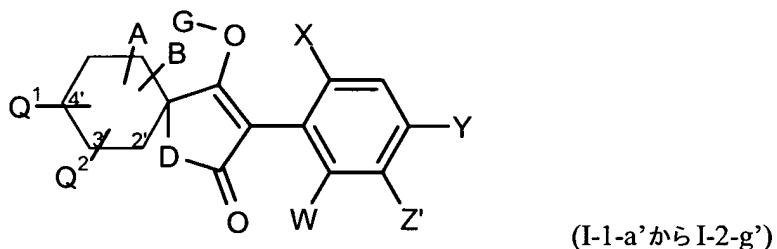
[式中、L、R⁶及びR⁷は、上記で与えられている意味を有する。]

の塩化カルバモイル又は塩化チオカルバモイルと反応させれば、得られる；

(J) 上記で示されている式(I-1-a)から式(I-2-g) [式中、A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。]の化合物は、式(I-1-a')から式(I-2-g')

【0036】

【化19】

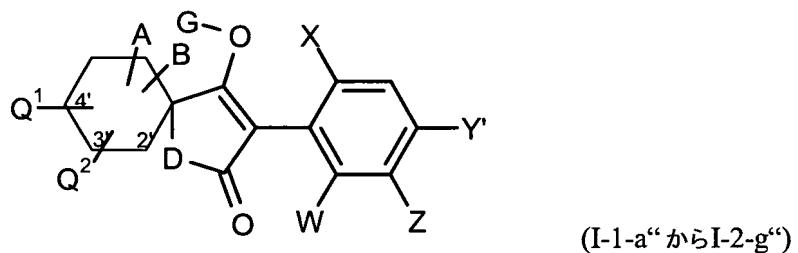


[式中、A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X及びYは上記で与えられている意味を有し、Z'は、好ましくは、臭素又はヨウ素を表す。]の化合物を、及び、

(J) 上記で示されている式(I-1-a)から式(I-2-g) [式中、A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。]の化合物は、式(I-1-a")から式(I-2-g")

【0037】

【化20】

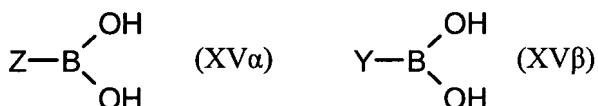


[式中、A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X及びZは上記で与えられている意味を有し、Y'は、好ましくは、臭素又はヨウ素を表す。]の化合物を、

溶媒の存在下、触媒(例えば、Pd錯体)の存在下、及び、塩基(例えば、炭酸ナトリウム、リン酸カリウム)の存在下で、カップリング可能な(ヘタ)アリール誘導体(例えば、式(XV)及び式(XVI))

【0038】

【化 21】



のフェニルボロン酸又はそのエステル]とカップリングさせれば得られる。

【0039】

さらに、式(I)の新規化合物が、殺有害生物剤として、好ましくは、殺虫剤及び/又は殺ダニ剤及び/又は除草剤として、非常に有効であり、及び、加えて、多くの場合、式(I)の新規化合物に対して植物(特に、作物植物)が極めて良好な耐性を示すということが分かった。
10

【0040】

驚くべきことに、特定のオキサスピロ環式スピロ置換テトラミン酸及びテトロン酸誘導体が、以下に記載されている作物植物の適合性を改善する化合物(薬害軽減剤/解毒剤)と一緒に使用されたときに、作物植物に対する損傷を効果的に防止し、及び、有用な植物の作物(例えば、穀類や、さらに、トウモロコシ、ダイズ及びイネなど)における望ましくない植物を選択的に防除するための広いスペクトルを有する組合せ調製物として特に有利に使用することが可能であるということも見いだされた。

【0041】

本発明は、さらにまた、有効量の活性化合物組合せを含んでいる選択的除草剤組成物も提供し、ここで、該組合せは、成分として、以下のものを含んでいる:

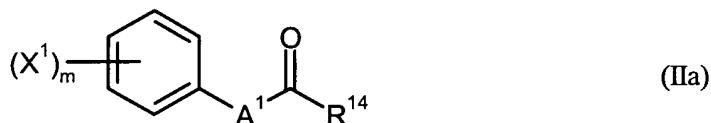
(a') 式(I)[式中、A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で定義されているとおりである。]の少なくとも1種類の化合物;
及び、

(b') 以下の化合物の群から選択される作物植物の適合性を改善する少なくとも1種類の化合物:

4-ジクロロアセチル-1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン(AD-67、MON-4660)、1-ジクロロアセチルヘキサヒドロ-3,3,8a-トリメチルスピロ[1,2-a]ピリミジン-6(2H)-オン(ジシクロノン(dicyclonon)、BAS-145138)、4-ジクロロアセチル-3,4-ジヒドロ-3-メチル-2H-1,4-ベンゾオキサジン(ベノキサコール)、1-メチルヘキシリ-5-クロロキノリン-8-オキシアセテート(クロキントセット-メキシリ cf. さらに、EP-A-86750、EP-A-94349、EP-A-191736、EP-A-492366の中の関連化合物)、3-(2-クロロベンジル)-1-(1-メチル-1-フェニルエチル)尿素(クミルロン)、-(シアノメトキシイミノ)フェニルアセトニトリル(シオメトリニル(cyometrinil))、2,4-ジクロロフェノキシ酢酸(2,4-D)、4-(2,4-ジクロロフェノキシ)醋酸(2,4-DB)、1-(1-メチル-1-フェニルエチル)-3-(4-メチルフェニル)尿素(ダイムロン(daimuron, dymron))、3,6-ジクロロ-2-メトキシ安息香酸(ジカンバ)、S-1-メチル-1-フェニルエチル ピペリジン-1-チオカルボキシレート(ジメピレート)、2,2-ジクロロ-N-(2-オキソ-2-(2-プロペニルアミノ)エチル)-N-(2-プロペニル)アセトアミド(DKA-24)、2,2-ジクロロ-N,N-ジ-2-プロペニルアセトアミド(ジクロルミド)、4,6-ジクロロ-2-フェニルピリミジン(フェンクロリム)、1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-トリクロロメチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-カルボン酸エチル(フェンクロラゾール-エチル) cf. さらに、EP-A-174562及びEP-A-346620の中の関連化合物)、2-クロロ-4-トリフルオロメチルチアゾール-5-カルボン酸フェニルメチル(フルラゾール)、4-クロロ-N-(1,3-ジオキソラン-2-イルメトキシ)-トリフルオロアセトフェノンオキシム(フルキソフェニム)、3-ジクロロアセチル-5-(2-フラニル)-2,2-ジメチルオキサゾリジン(フリラゾール、MON-1390
30
40
50

0) 、 4 , 5 - ジヒドロ - 5 , 5 - ジフェニル - 3 - イソオキサゾールカルボン酸エチル (イソキサジフェン - エチル) - cf. さらに、WO-A-95/07897 の中の関連化合物) 、
 1 - (エトキシカルボニル) エチル - 3 , 6 - ジクロロ - 2 - メトキシベンゾエート (ラクチジクロル) 、 (4 - クロロ - o - トリルオキシ) 酢酸 (M C P A) 、 2 - (4 - クロロ - o - トリルオキシ) プロピオン酸 (メコプロップ) 、 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 , 5 - ジカルボン酸ジエチル (メフェンピル - ジエチル) - cf. さらに、WO-A-91/07874 の中の関連化合物) 、
 2 - ジクロロメチル - 2 - メチル - 1 , 3 - ジオキソラン (M G - 191) 、 2 - プロペニル - 1 - オキサ - 4 - アザスピロ [4 . 5] デカン - 4 - カルボジチオエート (M G - 838) 、 1 , 8 - ナフタル酸無水物、 - (1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イルメトキシイミノ) フェニルアセトニトリル (オキサベトリニル) 、 2 , 2 - ジクロロ - N - (1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イルメチル) - N - (2 - プロペニル) アセトアミド (P P G - 1292) 、 3 - ジクロロアセチル - 2 , 2 - ジメチルオキサゾリジン (R - 28725) 、 3 - ジクロロアセチル - 2 , 2 , 5 - トリメチルオキサゾリジン (R - 29148) 、
 4 - (4 - クロロ - o - トリル) 酢酸、 4 - (4 - クロロフェノキシ) 酢酸、 ジフェニルメトキシ酢酸、 ジフェニルメトキシ酢酸メチル、 ジフェニルメトキシ酢酸エチル、 1 - (2 - クロロフェニル) - 5 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸メチル、 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸エチル、 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - イソプロピル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸エチル、 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸エチル、 1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸エチル (cf. さらに、EP-A-269806 及び EP-A-333131 の中の関連化合物) 、 5 - (2 , 4 - ジクロロベンジル) - 2 - イソオキサゾリン - 3 - カルボン酸エチル、 5 - フェニル - 2 - イソオキサゾリン - 3 - カルボン酸エチル、 5 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - フェニル - 2 - イソオキサゾリン - 3 - カルボン酸エチル (cf. さらに、WO-A-91/08202 の中の関連化合物) 、 1 , 3 - ジメチルブト - 1 - イル - 5 - クロロキノリン - 8 - オキシアセテート、 4 - アリルオキシブチル - 5 - クロロキノリン - 8 - オキシアセテート、 1 - アリルオキシプロブ - 2 - イル - 5 - クロロキノリン - 8 - オキシアセテート、 メチル - 5 - クロロキノキサリン - 8 - オキシアセテート、 エチル - 5 - クロロキノリン - 8 - オキシアセテート、 アリル - 5 - クロロキノキサリン - 8 - オキシアセテート、 2 - オキソプロブ - 1 - イル - 5 - クロロキノリン - 8 - オキシアセテート、 ジエチル - 5 - クロロキノリン - 8 - オキシマロネート、 ジアリル - 5 - クロロキノキサリン - 8 - オキシマロネート、 ジエチル - 5 - クロロキノリン - 8 - オキシマロネート (cf. さらに、EP-A-582198 の中の関連化合物) 、 4 - カルボキシクロマン - 4 - イル酢酸 (A C - 304415、 cf. EP-A-613618) 、 4 - クロロフェノキシ酢酸、 3 , 3' - ジメチル - 4 - メトキシベンゾフェノン、 1 - ブロモ - 4 - クロロメチルスルホニルベンゼン、 1 - [4 - (N - 2 - メトキシベンゾイル) - 4 - [(メチルアミノカルボニル) アミノ] ベンゼンスルホニアミド」としても知られている。) 、
 1 - [4 - (N - 2 - メトキシベンゾイルスルホニアミル) フェニル] - 3 , 3 - ジメチル尿素、 1 - [4 - (N - 4 , 5 - ジメチルベンゾイルスルホニアミル) フェニル] - 3 - メチル尿素、 1 - [4 - (N - ナフチルスルホニアミル) フェニル] - 3 , 3 - ジメチル尿素、 N - (2 - メトキシ - 5 - メチルベンゾイル) - 4 - (シクロプロピルアミノカルボニル) ベンゼンスルホニアミド、
 及び / 又は、一般式で定義されている以下の化合物のうちの 1 種類：
 一般式 (I I a)
 【0042】

【化22】



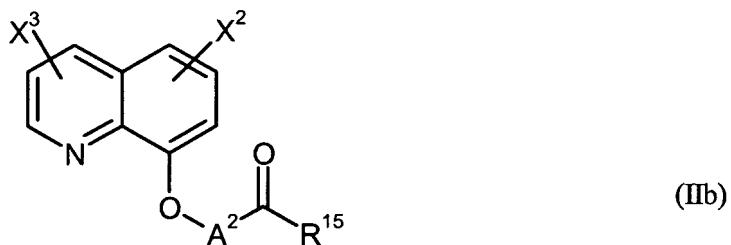
の化合物、若しくは、

一般式 (IIb)

【0043】

【化23】

10



の化合物、若しくは、

一般式 (IIc)

20

【0044】

【化24】



の化合物

[上記式中、

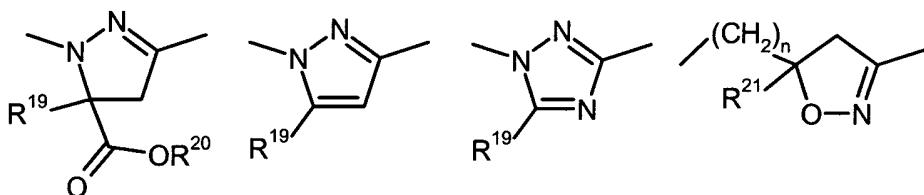
30

m は、数 0、1、2、3、4 又は 5 を表し、

A¹ は、以下に示されている二価ヘテロ環式基

【0045】

【化25】



40

のうちの 1 つを表し、

n は、数 0、1、2、3、4 又は 5 を表し、

A² は、C₁ - C₄ - アルキル及び / 又は C₁ - C₄ - アルコキシ - カルボニル及び / 又は C₁ - C₄ - アルケニルオキシカルボニルで置換されていてもよい 1 個又は 2 個の炭素原子を有するアルカンジイルを表し、

R¹⁻⁴ は、ヒドロキシリル、メルカプト、アミノ、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルアミノ又はジ(C₁ - C₄ - アルキル)アミノを表し、

R¹⁻⁵ は、ヒドロキシリル、メルカプト、アミノ、C₁ - C₇ - アルコキシ、C₁ - C₆

50

- アルキルチオ、C₁ - C₆ - アルケニルオキシ、C₁ - C₆ - アルケニルオキシ - C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルアミノ又はジ(C₁ - C₄ - アルキル)アミノを表し、

R¹⁶は、フッ素、塩素及び/又は臭素で置換されてもよいC₁ - C₄ - アルキルを表し、

R¹⁷は、水素を表すか、又は、それぞれフッ素、塩素及び/若しくは臭素で置換されてもよいC₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル若しくはC₂ - C₆ - アルキニル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、ジオキソラニル - C₁ - C₄ - アルキル、フリル、フリル - C₁ - C₄ - アルキル、チエニル、チアゾリル、ピペリジニルを表すか、又は、フッ素、塩素及び/若しくは臭素若しくはC₁ - C₄ - アルキルで置換されてもよいフェニルを表し、

R¹⁸は、水素を表すか、又は、それぞれフッ素、塩素及び/若しくは臭素で置換されてもよいC₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル若しくはC₂ - C₆ - アルキニル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、ジオキソラニル - C₁ - C₄ - アルキル、フリル、フリル - C₁ - C₄ - アルキル、チエニル、チアゾリル、ピペリジニルを表すか、又は、フッ素、塩素及び/若しくは臭素若しくはC₁ - C₄ - アルキルで置換されてもよいフェニルを表し、R¹⁷とR¹⁸は、さらにまた、一緒にあって、C₃ - C₆ - アルカンジイル又はC₂ - C₅ - オキサアルカンジイル(これらは、それぞれ、C₁ - C₄ - アルキル、フェニル、フリル若しくは縮合ベンゼン環で置換されてもよいか、又は、2つの置換基で置換されてもよく、その際、該2つの置換基は、それらが結合しているC原子と一緒に5員又は6員の炭素環を形成している。)も表し、

R¹⁹は、水素、シアノ若しくはハロゲンを表すか、又は、それぞれフッ素、塩素及び/若しくは臭素で置換されてもよいC₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル若しくはフェニルを表し、

R²⁰は、水素を表すか、又は、それぞれヒドロキシリ、シアノ、ハロゲン若しくはC₁ - C₄ - アルコキシで置換されてもよいC₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル若しくはトリ-(C₁ - C₄ - アルキル)シリルを表し、

R²¹は、水素、シアノ若しくはハロゲンを表すか、又は、それぞれフッ素、塩素及び/若しくは臭素で置換されてもよいC₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル若しくはフェニルを表し、

X¹は、ニトロ、シアノ、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ又はC₁ - C₄ - ハロアルコキシを表し、

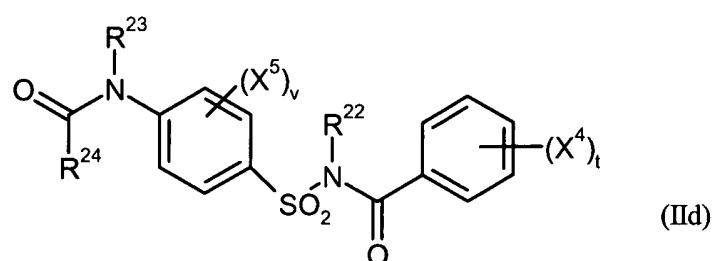
X²は、水素、シアノ、ニトロ、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ又はC₁ - C₄ - ハロアルコキシを表し、

X³は、水素、シアノ、ニトロ、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ又はC₁ - C₄ - ハロアルコキシを表す。]、及び/又は、一般式で定義されている以下の化合物：

一般式(IId)

【0046】

【化26】



の化合物、若しくは、

一般式(IIE)

10

20

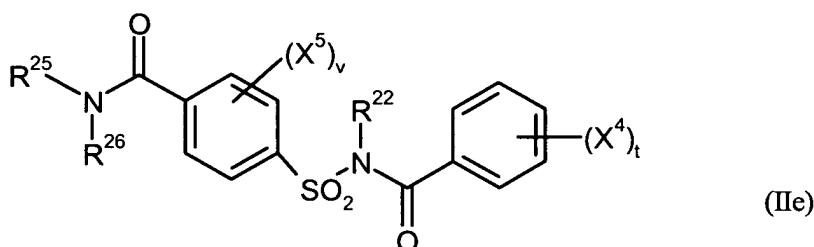
30

40

50

【0047】

【化27】



10

の化合物

[上記式中、

t は、数 0、1、2、3、4 又は 5 を表し、
v は、数 0、1、2、3、4 又は 5 を表し、
R²² は、水素又は C₁ - C₄ - アルキルを表し、
R²³ は、水素又は C₁ - C₄ - アルキルを表し、
R²⁴ は、水素を表すか、又は、それぞれシアノ、ハロゲン若しくは C₁ - C₄ - アルコキシで置換されていてもよい C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルアミノ若しくはジ (C₁ - C₄ - アルキル) アミノを表すか、又は、それぞれシアノ、ハロゲン若しくは C₁ - C₄ - アルキルで置換されていてもよい C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキルオキシ、C₃ - C₆ - シクロアルキルチオ若しくは C₃ - C₆ - シクロアルキルアミノを表し、

R²⁵ は、水素を表すか、又は、シアノ、ヒドロキシリ、ハロゲン若しくは C₁ - C₄ - アルコキシで置換されていてもよい C₁ - C₆ - アルキルを表すか、又は、それぞれシアノ若しくはハロゲンで置換されていてもよい C₃ - C₆ - アルケニル若しくは C₃ - C₆ - アルキニルを表すか、又は、シアノ、ハロゲン若しくは C₁ - C₄ - アルキルで置換されていてもよい C₃ - C₆ - シクロアルキルを表し、

R²⁶ は、水素を表すか、又は、シアノ、ヒドロキシリ、ハロゲン若しくは C₁ - C₄ - アルコキシで置換されていてもよい C₁ - C₆ - アルキルを表すか、又は、それぞれシアノ若しくはハロゲンで置換されていてもよい C₃ - C₆ - アルケニル若しくは C₃ - C₆ - アルキニルを表すか、又は、シアノ、ハロゲン若しくは C₁ - C₄ - アルキルで置換されていてもよい C₃ - C₆ - シクロアルキルを表すか、又は、ニトロ、シアノ、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ若しくは C₁ - C₄ - ハロアルコキシで置換されていてもよいフェニルを表すか、又は、R²⁵ と一緒にになって、それぞれ C₁ - C₄ - アルキルで置換されていてもよい C₂ - C₆ - アルカンジイル若しくは C₂ - C₅ - オキサアルカンジイルを表し、

X⁴ は、ニトロ、シアノ、カルボキシリ、カルバモイル、ホルミル、スルファモイル、ヒドロキシリ、アミノ、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ又は C₁ - C₄ - ハロアルコキシを表し、及び、

X⁵ は、ニトロ、シアノ、カルボキシリ、カルバモイル、ホルミル、スルファモイル、ヒドロキシリ、アミノ、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ又は C₁ - C₄ - ハロアルコキシを表す。]。

【発明を実施するための形態】

【0048】

式 (I) は、本発明の化合物の一般的な定義を与えている。上記及び下記で記載されている式において挙げられている好ましい置換基又は基の好ましい範囲について、以下に例示する：

W は、好ましくは、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニルを表すか、C₃ - C₆ - シクロアルキル (該シクロアルキルは、C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₂ - アルコキシ、フッ素、塩素、トリフルオロメチル又は C₃ -

50

C_6 - シクロアルキルで一置換又は二置換されていてもよい。)を表すか、又は、ハロゲン、 C_1 - C_6 - アルコキシ、 C_1 - C_4 - ハロアルキル、 C_1 - C_4 - ハロアルコキシ若しくはシアノを表し、

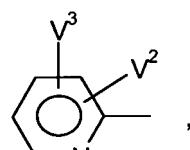
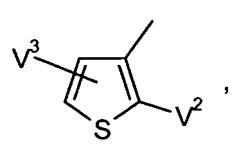
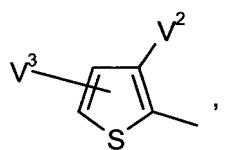
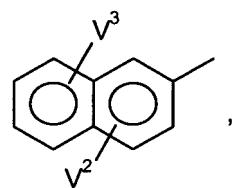
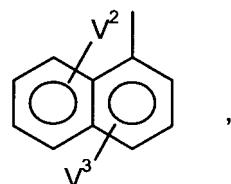
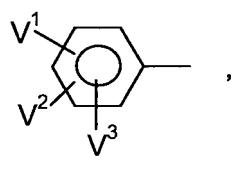
X は、好ましくは、ハロゲン、 C_1 - C_6 - アルキル、 C_2 - C_6 - アルケニル、 C_2 - C_6 - アルキニルを表すか、 C_3 - C_6 - シクロアルキル(該シクロアルキルは、 C_1 - C_2 - アルキル、 C_1 - C_2 - アルコキシ、フッ素、塩素、トリフルオロメチル又は C_3 - C_6 - シクロアルキルで一置換又は二置換されていてもよい。)を表すか、 C_1 - C_6 - ハロアルキル、 C_1 - C_6 - アルコキシ、 C_3 - C_6 - アルケニルオキシ、 C_1 - C_6 - アルキルチオ、 C_1 - C_6 - アルキルスルフィニル、 C_1 - C_6 - アルキルスルホニル、 C_1 - C_6 - ハロアルコキシ、 C_3 - C_6 - ハロアルケニルオキシ、ニトロ若しくはシアノを表し、10

Y 及び Z は、互いに独立して、好ましくは、水素、ハロゲン、 C_1 - C_6 - アルキル、 C_2 - C_6 - アルケニル、 C_2 - C_6 - アルキニルを表すか、 C_3 - C_6 - シクロアルキル(該シクロアルキルは、 C_1 - C_2 - アルキル、 C_1 - C_2 - アルコキシ、フッ素、塩素、トリフルオロメチル又は C_3 - C_6 - シクロアルキルで一置換又は二置換されていてもよい。)を表すか、 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、シアノ、 C_2 - C_6 - アルケニル若しくは C_2 - C_6 - アルキニルを表すか、又は、(ヘタ)アリール基

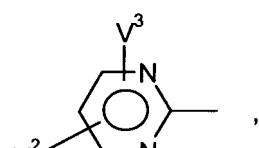
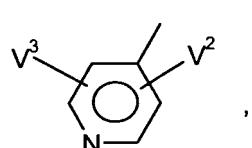
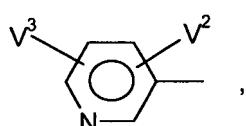
【0049】

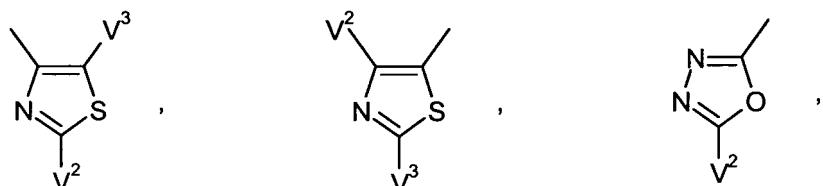
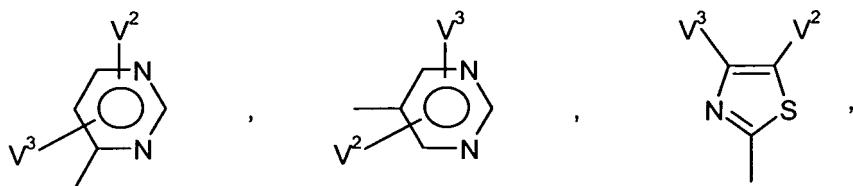
【化28】

20

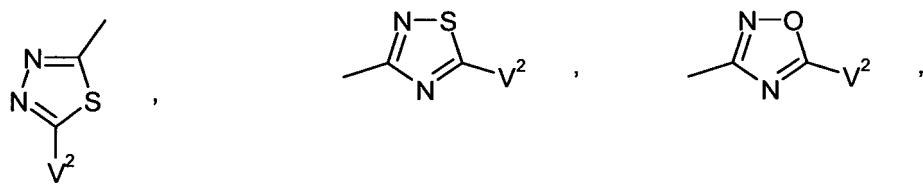


30

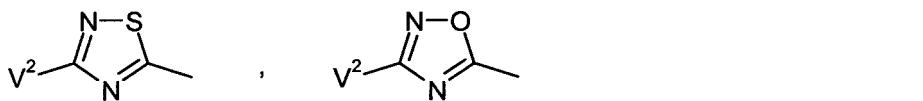




10



20



30

のうちの1つを表し((ヘタ)アリールの場合、基Y又はZの一方のみが(ヘタ)アリールを表すことができる。);

V¹は、好ましくは、水素、ハロゲン、C₁-C₁₂-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-ハロアルコキシ、ニトロ若しくはシアノを表すか、又は、フェニル、フェノキシ、フェノキシ-C₁-C₄-アルキル、フェニル-C₁-C₄-アルコキシ、フェニルチオ-C₁-C₄-アルキル若しくはフェニル-C₁-C₄-アルキルチオ(これらは、それぞれ、ハロゲン、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-ハロアルコキシ、ニトロ又はシアノで一置換又は多置換されていてもよい。)を表し、

V²及びV³は、互いに独立して、好ましくは、水素、ハロゲン、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルキル又はC₁-C₄-ハロアルコキシを表し、

A及びBとそれらが結合している炭素原子(3'位又は4'位)は、好ましくは、テトラヒドロフラン環又はテトラヒドロピラン環(該テトラヒドロフラン環又はテトラヒドロピラン環は、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ又はC₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキルで一置換又は二置換されていてもよい。)を表し、

Dは、好ましくは、NH(1)又は酸素(2)を表し、

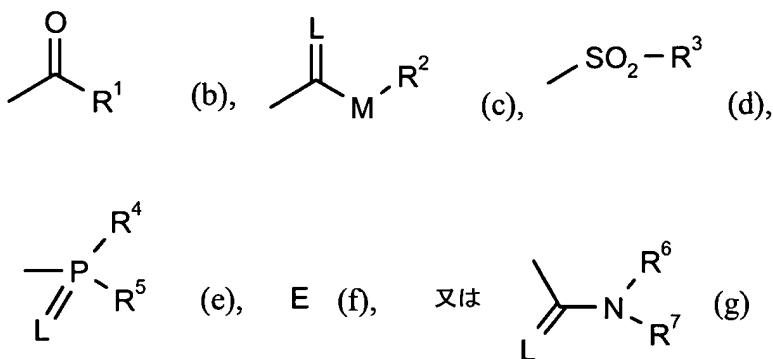
Q¹及びQ²は、互いに独立して、好ましくは、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₂-ハロアルキル又はC₁-C₄-アルコキシを表し、

Gは、好ましくは、水素(a)を表すか、又は、以下の基

【0050】

40

【化29】



10

のうちの1つを表し、

ここで、

Eは、金属イオン又はアンモニウムイオンを表し、

Lは、酸素又は硫黄を表し、

Mは、酸素又は硫黄を表し、

R¹は、好ましくは、それぞれハロゲン若しくはシアノで置換されていてもよいC₁-C₂₀-アルキル、C₂-C₂₀-アルケニル、C₁-C₈-アルコキシ-C₁-C₈-アルキル、C₁-C₈-アルキルチオ-C₁-C₈-アルキル若しくはポリ-C₁-C₈-アルコキシ-C₁-C₈-アルキルを表すか、又は、ハロゲン、C₁-C₆-アルキル若しくはC₁-C₆-アルコキシで置換されていてもよいC₃-C₈-シクロアルキル(1つ又は2つの直接には隣接していないメチレン基は酸素及び/又は硫黄で置き換えられてもよい。)を表し、

又は、

R¹は、好ましくは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ又はC₁-C₆-アルキルスルホニルで置換されていてもよいフェニルを表し、

又は、

R¹は、好ましくは、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルキル又はC₁-C₆-ハロアルコキシで置換されていてもよいフェニル-C₁-C₆-アルキルを表し、

又は、

R¹は、好ましくは、ハロゲン又はC₁-C₆-アルキルで置換されていてもよい5員又は6員のヘタリール(該ヘタリールは、酸素、硫黄及び窒素からなる群の1個又は2個のヘテロ原子を有している。)を表し、

又は、

R¹は、好ましくは、ハロゲン又はC₁-C₆-アルキルで置換されていてもよいフェノキシ-C₁-C₆-アルキルを表し、

又は、

R¹は、好ましくは、ハロゲン、アミノ又はC₁-C₆-アルキルで置換されていてもよい5員又は6員のヘタリールオキシ-C₁-C₆-アルキル(該ヘタリールオキシ-C₁-C₆-アルキルは、酸素、硫黄及び窒素からなる群の1個又は2個のヘテロ原子を有している。)を表し、

R²は、好ましくは、それぞれハロゲン又はシアノで置換されていてもよいC₁-C₂₀-アルキル、C₂-C₂₀-アルケニル、C₁-C₈-アルコキシ-C₂-C₈-アルキル又はポリ-C₁-C₈-アルコキシ-C₂-C₈-アルキルを表し、

又は、

R²は、好ましくは、ハロゲン、C₁-C₆-アルキル又はC₁-C₆-アルコキシで

20

30

40

50

置換されていてもよいC₃ - C₈ - シクロアルキルを表し、
又は、

R²は、好ましくは、それぞれハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - ハロアルキル又はC₁ - C₆ - ハロアルコキシで置換されていてもよいフェニル又はベンジルを表し、

R³は、好ましくは、ハロゲンで置換されていてもよいC₁ - C₈ - アルキルを表すか、又は、それぞれハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、シアノ若しくはニトロで置換されていてもよいフェニル若しくはベンジルを表し、

R⁴及びR⁵は、互いに独立して、好ましくは、それぞれハロゲンで置換されていてもよいC₁ - C₈ - アルキル、C₁ - C₈ - アルコキシ、C₁ - C₈ - アルキルアミノ、ジ-(C₁ - C₈ - アルキル)アミノ、C₁ - C₈ - アルキルチオ若しくはC₃ - C₈ - アルケニルチオを表すか、又は、それぞれハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、C₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、C₁ - C₄ - アルキル若しくはC₁ - C₄ - ハロアルキルで置換されていてもよいフェニル、フェノキシ若しくはフェニルチオを表し、

R⁶及びR⁷は、互いに独立して、好ましくは、水素を表すか、又は、それぞれハロゲン若しくはシアノで置換されていてもよいC₁ - C₈ - アルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル、C₁ - C₈ - アルコキシ、C₃ - C₈ - アルケニル若しくはC₁ - C₈ - アルコキシ-C₂ - C₈ - アルキルを表すか、又は、それぞれハロゲン、C₁ - C₈ - アルキル、C₁ - C₈ - ハロアルキル若しくはC₁ - C₈ - アルコキシで置換されていてもよいフェニル若しくはベンジルを表すか、又は、一緒になって、C₁ - C₆ - アルキルで置換されていてもよいC₃ - C₆ - アルキレン基(1つのメチレン基は、酸素又は硫黄で置き換えられていてもよい。)を表す。

【0051】

好ましいものとして挙げられている基の定義において、ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素を表し、特に、フッ素、塩素及び臭素を表す。

【0052】

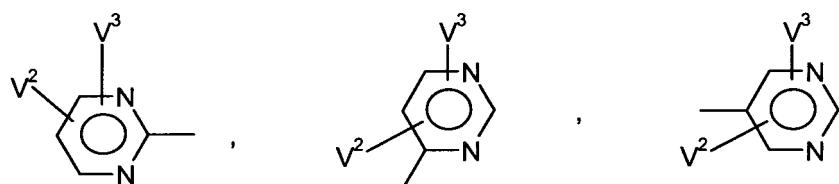
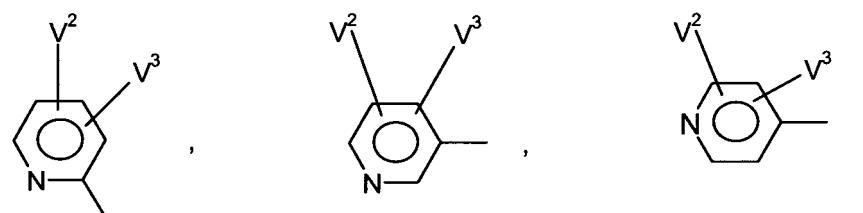
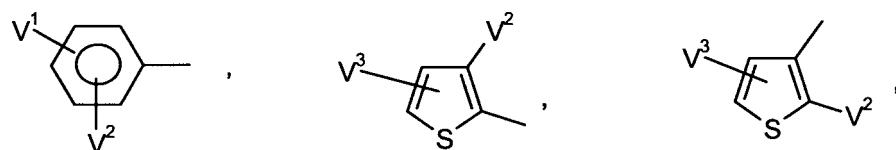
Wは、特に好ましくは、水素、塩素、臭素、C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - アルキニルを表すか、C₃ - C₆ - シクロアルキル(該シクロアルキルは、メチル、エチル、メトキシ、フッ素、塩素、トリフルオロメチル又はシクロプロピルで一置換されていてもよい。)を表すか、又は、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₂ - ハロアルキル若しくはC₁ - C₂ - ハロアルコキシを表し、

Xは、特に好ましくは、塩素、臭素、C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - アルキニルを表すか、C₃ - C₆ - シクロアルキル(該シクロアルキルは、メチル、エチル、メトキシ、フッ素、塩素、トリフルオロメチル又はシクロプロピルで一置換されていてもよい。)を表すか、又は、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ若しくはシアノを表し、

Y及びZは、互いに独立して、特に好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - アルキニルを表すか、C₃ - C₆ - シクロアルキル(該シクロアルキルは、メチル、エチル、メトキシ、フッ素、塩素、トリフルオロメチル又はシクロプロピルで一置換されていてもよい。)を表すか、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、シアノ、C₂ - C₄ - アルケニル若しくはC₂ - C₄ - アルキニルを表すか、又は、(ヘタ)アリール基

【0053】

【化 3 0】



10

20

のうちの1つを表し((ヘタ)アリールの場合、基Y又はZの一方のみが(ヘタ)アリールを表すことができる。);

V¹は、特に好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₂-ハロアルキル、C₁-C₂-ハロアルコキシ、ニトロ若しくはシアノを表すか、又は、フェニル(該フェニルは、フッ素、塩素、臭素、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₂-ハロアルキル、C₁-C₂-ハロアルコキシ、ニトロ又はシアノで一置換又は二置換されていてもよい。)を表し、

V²及びV³は、互いに独立して、特に好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₂-ハロアルキル又はC₁-C₂-ハロアルコキシを表し、

30

A及びBとそれらが結合している炭素原子(3'位又は4'位)は、特に好ましくは、テトラヒドロフラン環又はテトラヒドロピラン環(該テトラヒドロフラン環又はテトラヒドロピラン環は、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₃-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ又はC₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₂-アルキルで一置換されていてもよい。)を表し、

Dは、特に好ましくは、NH(1)又は酸素(2)を表し、

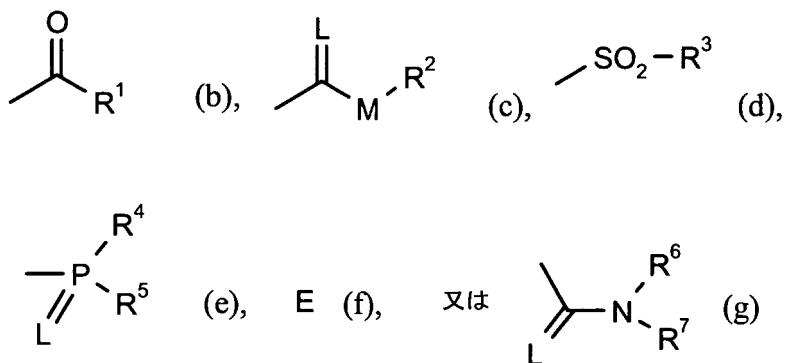
Q¹及びQ²は、互いに独立して、特に好ましくは、水素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ又はエトキシを表し、

Gは、特に好ましくは、水素(a)を表すか、又は、以下の基

【0054】

40

【化31】



10

のうちの1つを表し、

ここで、

Eは、金属イオン又はアンモニウムイオンを表し、

Lは、酸素又は硫黄を表し、

Mは、酸素又は硫黄を表し、

R¹は、特に好ましくは、C₁-C₁₆-アルキル、C₂-C₁₆-アルケニル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキル若しくはポリ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル（これらは、それぞれ、フッ素又は塩素で一置換から三置換されていてもよい。）を表すか、又は、C₃-C₇-シクロアルキル（該シクロアルキルは、フッ素、塩素、C₁-C₅-アルキル又はC₁-C₅-アルコキシで一置換又は二置換されていてもよく、また、1つ又は2つの直接には隣接していないメチレン基は酸素及び/又は硫黄で置き換えられていてもよい。）を表し、

フェニル（該フェニルは、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₃-ハロアルキル、C₁-C₃-ハロアルコキシ、C₁-C₄-アルキルチオ又はC₁-C₄-アルキルスルホニルで一置換から三置換されていてもよい）を表し、

フェニル-C₁-C₄-アルキル（該フェニル-C₁-C₄-アルキルは、フッ素、塩素、臭素、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₃-ハロアルキル又はC₁-C₃-ハロアルコキシで一置換又は二置換されていてもよい）を表し、

ピラゾリル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジル、フラニル又はチエニル（これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素又はC₁-C₄-アルキルで一置換又は二置換されていてもよい。）を表し、

フェノキシ-C₁-C₅-アルキル（該フェノキシ-C₁-C₅-アルキルは、フッ素、塩素、臭素又はC₁-C₄-アルキルで一置換又は二置換されていてもよい。）を表し、又は

ピリジルオキシ-C₁-C₅-アルキル、ピリミジルオキシ-C₁-C₅-アルキル又はチアゾリルオキシ-C₁-C₅-アルキル（これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、アミノ又はC₁-C₄-アルキルで一置換又は二置換されていてもよい。）を表し、

R²は、特に好ましくは、C₁-C₁₆-アルキル、C₂-C₁₆-アルケニル、C₁-C₆-アルコキシ-C₂-C₆-アルキル又はポリ-C₁-C₆-アルコキシ-C₂-C₆-アルキル（これらは、それぞれ、フッ素又は塩素で一置換から三置換されていてもよい。）を表し、

C₃-C₇-シクロアルキル（該シクロアルキルは、フッ素、塩素、C₁-C₄-アルキル又はC₁-C₄-アルコキシで一置換又は二置換されていてもよい。）を表し、又は

フェニル又はベンジル（これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₃-アルコキシ、C₁-C₃-ハロアルキル又はC₁-C₃-ハロアルコキシで一置換から三置換されていてもよい。）を表し、

20

30

40

50

R³は、特に好ましくは、C₁ - C₆ - アルキル（該アルキルは、フッ素又は塩素で一置換から三置換されていてもよい。）を表すか、又は、フェニル若しくはベンジル（これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₂ - ハロアルコキシ、C₁ - C₂ - ハロアルキル、シアノ又はニトロで一置換又は二置換されていてもよい。）を表し、

R⁴及びR⁵は、互いに独立して、特に好ましくは、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルアミノ、ジ-(C₁ - C₆ - アルキル)アミノ、C₁ - C₆ - アルキルチオ若しくはC₃ - C₄ - アルケニルチオ（これらは、それぞれ、フッ素又は塩素で一置換から三置換されていてもよい。）を表すか、又は、フェニル、フェノキシ若しくはフェニルチオ（これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、C₁ - C₃ - アルコキシ、C₁ - C₃ - ハロアルコキシ、C₁ - C₃ - アルキルチオ、C₁ - C₃ - ハロアルキルチオ、C₁ - C₃ - アルキル又はC₁ - C₃ - ハロアルキルで一置換又は二置換されていてもよい。）を表し、

R⁶及びR⁷は、互いに独立して、特に好ましくは、水素を表すか、又は、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₃ - C₆ - アルケニル若しくはC₁ - C₆ - アルコキシ-C₂ - C₆ - アルキル（これらは、それぞれ、フッ素又は塩素で一置換から三置換されていてもよい。）を表すか、又は、フェニル若しくはベンジル（これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、C₁ - C₅ - ハロアルキル、C₁ - C₅ - アルキル又はC₁ - C₅ - アルコキシで一置換から三置換されていてもよい。）を表すか、又は、一緒にになって、C₁ - C₄ - アルキルで置換されていてもよいC₃ - C₆ - アルキレン基（1つのメチレン基は、酸素又は硫黄で置き換えられていてもよい。）を表す。

【0055】

特に好ましいものとして挙げられている基の定義において、ハロゲンは、フッ素、塩素及び臭素を表し、特に、フッ素及び塩素を表す。

【0056】

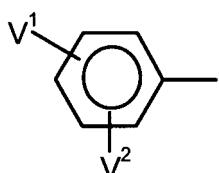
Wは、特に極めて好ましくは、水素、塩素、臭素、メチル、エチル、ビニル、エチニル、プロピニル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ又はトリフルオロメチルを表し、

Xは、特に極めて好ましくは、塩素、臭素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ビニル、エチニル、プロピニル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ又はシアノを表し、

Y及びZは、互いに独立して、特に極めて好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、ビニル、エチニル、プロピニル、シクロプロピル、メトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ若しくはシアノを表すか、又は、フェニル基

【0057】

【化32】



を表し（フェニルの場合、基Y又はZの一方のみがフェニルを表すことができる。）；

V¹は、特に極めて好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、tert-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル又はトリフルオロメトキシを表し、

V²は、特に極めて好ましくは、水素、フッ素、塩素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ又はトリフルオロメチルを表し、

A及びBとそれらが結合している炭素原子（3'位又は4'位）は、特に極めて好ましくは、テトラヒドロフラン環又はテトラヒドロピラン環（該テトラヒドロフラン環又はテ

10

20

30

40

50

トラヒドロピラン環は、メチル、エチル、プロピル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メトキシメチル又はエトキシメチルで一置換されていてもよい。)を表し、

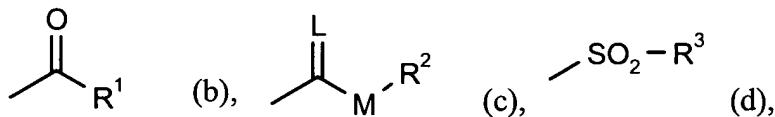
Dは、特に極めて好ましくは、NH(1)又は酸素(2)を表し、

Q¹及びQ²は、特に極めて好ましくは、水素を表し、

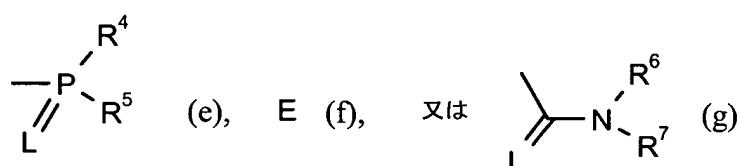
Gは、特に極めて好ましくは、水素(a)を表すか、又は、以下の基

【0058】

【化33】



10



のうちの1つを表し、

ここで、

Eは、金属イオン又はアンモニウムイオンを表し、

Lは、酸素又は硫黄を表し、

Mは、酸素又は硫黄を表し、

R¹は、特に極めて好ましくは、C₁-C₁₀-アルキル、C₂-C₁₀-アルケニル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₂-アルキル若しくはC₁-C₄-アルキルチオ-C₁-C₂-アルキル(これらは、それぞれ、フッ素又は塩素で一置換から三置換されていてもよい。)を表すか、又は、C₃-C₆-シクロアルキル(該シクロアルキルは、フッ素、塩素、メチル、エチル又はメトキシで一置換されていてもよい。)を表し、

フェニル(該フェニルは、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル又はトリフルオロメトキシで一置換又は二置換されていてもよい。)を表し、

フラニル、チエニル又はピリジル(これらは、それぞれ、塩素、臭素又はメチルで一置換されていてもよい。)を表し、

R²は、特に極めて好ましくは、C₁-C₁₀-アルキル、C₂-C₁₀-アルケニ又はC₁-C₄-アルコキシ-C₂-C₄-アルキル(これらは、それぞれ、フッ素又は塩素で一置換から三置換されていてもよい。)を表し、

シクロペンチル又はシクロヘキシルを表し、

又は、フェニル又はベンジル(これらは、それぞれ、フッ素、塩素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、メトキシ、トリフルオロメチル又はトリフルオロメトキシで一置換又は二置換されていてもよい。)を表し、

R³は、特に極めて好ましくは、メチル、エチル、プロピル若しくはイソプロピル(これらは、それぞれ、フッ素又は塩素で一置換から三置換されていてもよい。)を表すか、又は、フェニル(該フェニルは、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ又はニトロで一置換されていてもよい。)を表し、

R⁴及びR⁵は、互いに独立して、特に極めて好ましくは、C₁-C₄-アルコキシ若しくはC₁-C₄-アルキルチオを表すか、又は、フェニル、フェノキシ若しくはフェニルチオ(これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル又はトリフルオロメトキシで一置換されていてもよい。)を表し、

R⁶及びR⁷は、互いに独立して、特に極めて好ましくは、水素を表すか、又は、C₁

20

30

40

50

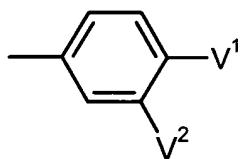
- C₄ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₃ - C₄ - アルケニル若しくはC₁ - C₄ - アルコキシ - C₂ - C₄ - アルキルを表すか、又は、フェニル(該フェニルは、フッ素、塩素、臭素、メチル、メトキシ又はトリフルオロメチルで一置換又は二置換されていてもよい。)を表すか、又は、一緒になって、C₅ - C₆ - アルキレン基(1つのメチレン基は、酸素又は硫黄で置き換えられていてもよい。)を表す。

【0059】

Wは、とりわけ好ましくは、水素、塩素、臭素、メチル、エチル又はメトキシを表し、Xは、とりわけ好ましくは、塩素、臭素、メチル、エチル又はメトキシを表し、Y及びZは、互いに独立して、とりわけ好ましくは、水素、塩素、臭素若しくはメチルを表すか、又は、基 10

【0060】

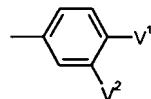
【化34】



を表し(この場合、基Y又はZの一方のみが 20

【0061】

【化35】



を表すことができる。);

A及びBとそれらが結合している炭素原子(4'位)は、とりわけ好ましくは、テトラヒドロフラン環(該テトラヒドロフラン環は、メチル、エチル、プロピル又はメトキメチルで一置換されていてもよい。)を表し、 30

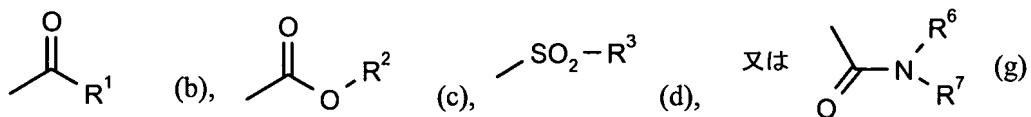
Dは、とりわけ好ましくは、NH(1)又は酸素(2)を表し、

Q¹及びQ²は、とりわけ好ましくは、水素を表し、

Gは、とりわけ好ましくは、水素(a)を表すか、又は、以下の基:

【0062】

【化36】



のうちの1つを表し、 40

R¹は、とりわけ好ましくは、C₁ - C₁₀ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₂ - アルキル又はC₃ - C₆ - シクロアルキルを表し、

フェニル(該フェニルは、塩素で一置換されていてもよい。)を表すか、又は、チエニルを表し、

R²は、とりわけ好ましくは、C₁ - C₁₀ - アルキル若しくはC₂ - C₁₀ - アルケニルを表すか、又は、ベンジルを表し、

R³は、とりわけ好ましくは、メチルを表し、

R⁶及びR⁷は、一緒になって、とりわけ好ましくは、C₅ - C₆ - アルキレン基(1つのメチレン基は、酸素又は硫黄で置き換えられていてもよい。)を表す。 50

【0063】

Wは、とりわけ極めて好ましくは、水素、塩素、臭素、メチル又はエチルを表し、

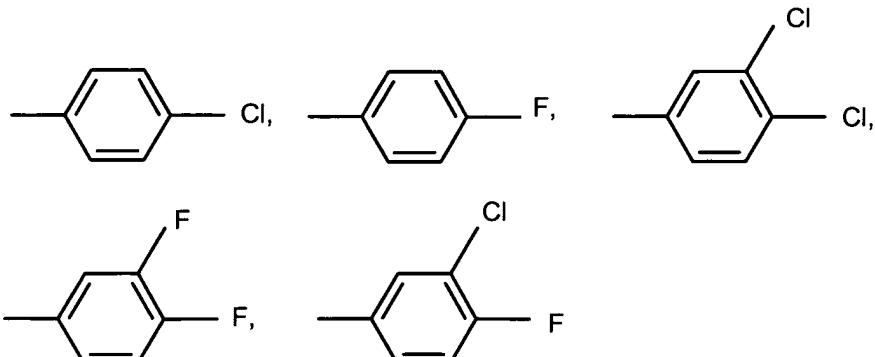
Xは、とりわけ極めて好ましくは、塩素、臭素、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ又はシクロプロピルを表し、

Yは、とりわけ極めて好ましくは、水素、メチル、エチル、塩素、臭素、ヨウ素、フッ素、トリフルオロメトキシ又はシクロプロピルを表し、

Zは、とりわけ極めて好ましくは、水素、臭素若しくはメチルを表すか、又は、基

【0064】

【化37】



10

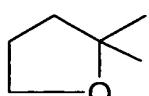
20

を表し、

A及びBとそれらが結合している炭素原子(4'位)は、とりわけ極めて好ましくは、

【0065】

【化38】



を表し、

Dは、とりわけ極めて好ましくは、NH(1)又は酸素(2)を表し、

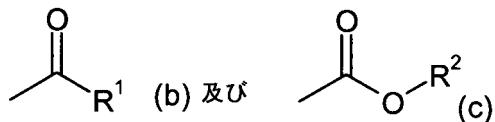
30

Q¹及びQ²は、とりわけ極めて好ましくは、水素を表し、

Gは、とりわけ極めて好ましくは、水素(a)を表すか、又は、以下の基:

【0066】

【化39】



のうちの1つを表し、

40

R¹は、とりわけ極めて好ましくは、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₂-アルキル又はシクロプロピルを表し、

R²は、とりわけ極めて好ましくは、C₁-C₆-アルキル又はベンジルを表す。

【0067】

上記で挙げられている基の一般的な又は好ましい定義又は実例は、必用に応じて互いに組み合わせることが可能であり、即ち、それぞれの範囲と好ましい範囲の間の組合せを包含する。それらは、最終生成物とそれに対応する前駆物質及び中間体の両方に適用される。

【0068】

本発明によれば、上記で好ましいものとして挙げられている意味の組合せを含んでいる

50

式(Ⅰ)の化合物は、好ましい。

【0069】

本発明によれば、上記で特に好ましいものとして挙げられている意味の組合せを含んでいる式(Ⅰ)の化合物は、特に好ましい。

【0070】

本発明によれば、上記で特に極めて好ましいものとして挙げられている意味の組合せを含んでいる式(Ⅰ)の化合物は、特に極めて好ましい。

【0071】

本発明によれば、上記でとりわけ好ましいものとして挙げられている意味の組合せを含んでいる式(Ⅰ)の化合物は、とりわけ好ましい。

10

【0072】

Gが水素を表す式(Ⅰ)の化合物は、重要である。

【0073】

飽和又は不飽和の炭化水素基、例えば、アルキル、アルカンジイル又はアルケニルなどは、それぞれ、可能である限り直鎖又は分枝鎖であり得るが、これは、例えばアルコキシのように、ヘテロ原子と組み合わされている場合も包含する。

【0074】

特に別途示されていない限り、置換されていてもよい基は、1置換又は多置換されることが可能であり、多置換の場合は、該置換基は同一であるか又は異なっていることが可能である。

20

【0075】

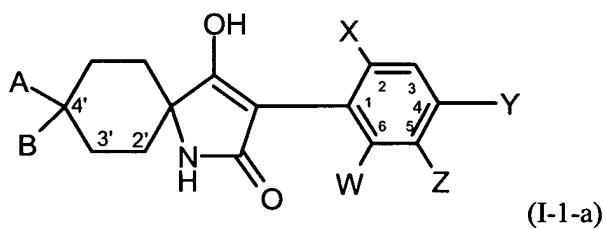
調製実施例において挙げられている化合物に加えて、式(Ⅰ-1-a)の以下の化合物を特に挙げることができる。

【0076】

表1 :

【0077】

【表1】

表1

10

A-B	X	W	Y	Z
------------	----------	----------	----------	----------

-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	H
--------------------------------------	-----------------	---	---	---

-O-(CH ₂) ₃ -	Br	H	H	H
--------------------------------------	----	---	---	---

-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	H	H
--------------------------------------	----	---	---	---

-O-(CH ₂) ₃ -	CF ₃	H	H	H
--------------------------------------	-----------------	---	---	---

20

-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	H	H	H
--------------------------------------	------------------	---	---	---

-O-(CH ₂) ₃ -	Br	H	Cl	H
--------------------------------------	----	---	----	---

-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	Br	H
--------------------------------------	----	---	----	---

-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	Cl	H
--------------------------------------	----	---	----	---

30

-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	CH ₃	H
--------------------------------------	----	---	-----------------	---

-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	Cl	H
--------------------------------------	-----------------	---	----	---

-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	Cl	H	H
--------------------------------------	----	----	---	---

-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	OCH ₃	H	H
--------------------------------------	----	------------------	---	---

40

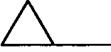
A-B	X	W	Y	Z	
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	H	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	OC ₂ H ₅	H	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	OCH ₃	H	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	H	10
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	CH ₃	Br	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	Cl	H	20
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	Br	CH ₃	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	Cl	CH ₃	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H	30
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	Br	CH ₃	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	Cl	CH ₃	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	Br	H	40
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H	

A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Cl	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Br	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Cl	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Br	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	C ₂ H ₅	Cl	H

A-B	X	W	Y	Z	
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₂ H ₅	CH ₃	Cl	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Cl	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	OCH ₃	CH ₃	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	OC ₂ H ₅	CH ₃	H	10
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	Cl	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	Cl	Cl	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	Cl	CH ₃	20
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	H	Cl	CH ₃	
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	H	CH ₃	CH ₃	
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	Br	CH ₃	
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	Cl	CH ₃	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	Br	CH ₃	30
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	CH ₃	Cl	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	CH ₃	Cl	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	CH ₃	
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	H	CH ₃	
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	H	H	CH ₃	40
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	Cl	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	Br	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	

A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	F
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	Cl
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	Br
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	Cl	H	Br
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl-C ₆ H ₄
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄
-O-(CH ₂) ₃ -	J	H	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	J	H	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	J	CH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	J	C ₂ H ₅	H	H

A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	J
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	CH ₃	J
-O-(CH ₂) ₃ -	J	CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	J	C ₂ H ₅	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	J	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	J	C ₂ H ₅	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	J	Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	J	H	CH ₃	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	J	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	H	J	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	J	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	J	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	J	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	J	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	C ₂ H ₅	J	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	J	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	J
-O-(CH ₂) ₃ -	J	H	H	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	H	H	H

A-B	X	W	Y	Z	
-O-(CH ₂) ₃ -		H	H	H	
-O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	H	H	
-O-(CH ₂) ₃ -		H	CH ₃	H	10
-O-(CH ₂) ₃ -		C ₂ H ₅	H	H	
-O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	CH ₃	H	
-O-(CH ₂) ₃ -		C ₂ H ₅	CH ₃	H	20
-O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	Cl	H	
-O-(CH ₂) ₃ -		C ₂ H ₅	Cl	H	
-O-(CH ₂) ₃ -		Cl	CH ₃	H	30
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H		H	
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	H		H	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃		H	40
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃		H	
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅		H	

A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃		H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	C ₂ H ₅		H

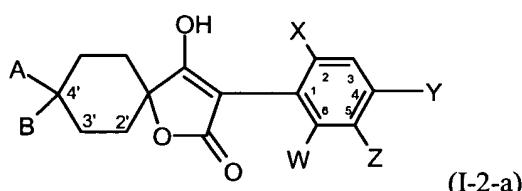
【0078】

調製実施例において挙げられている化合物に加えて、式(I-2-a)の以下の化合物 10
を特に挙げることができる。

【0079】

【表2】

表2



A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	H	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CF ₃	H	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	H	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	H	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	Cl	H

10

20

30

40

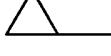
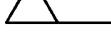
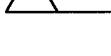
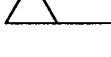
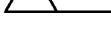
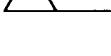
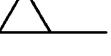
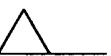
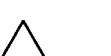
A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	Cl	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	OCH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	OC ₂ H ₅	H	10
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	OCH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	20
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	CH ₃	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	Br	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	30
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	Br	CH ₃	40
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H

A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Cl	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Br	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Cl	Br	H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	Br	Cl	H

A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OCH ₃	C ₂ H ₅	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₂ H ₅	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	OCH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	OC ₂ H ₅	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	Cl	Cl
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	Cl	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	H	Cl	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	H	CH ₃	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	Br	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	Cl	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	Br	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	CH ₃	Cl
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	H	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	Br	H	H	CH ₃
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	Cl

A-B	X	W	Y	Z	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	Br	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	F	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	10
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	Cl	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	Br	
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	Cl	H	Br	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	20
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	H	30
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl-C ₆ H ₄	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	40
-O-(CH ₂) ₃ -	J	H	H	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	J	H	CH ₃	H	

A-B	X	W	Y	Z	
-O-(CH ₂) ₃ -	J	CH ₃	H	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	J	C ₂ H ₅	H	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	H	J	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	CH ₃	J	10
-O-(CH ₂) ₃ -	J	CH ₃	CH ₃	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	J	C ₂ H ₅	CH ₃	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	J	CH ₃	Cl	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	J	C ₂ H ₅	Cl	H	20
-O-(CH ₂) ₃ -	J	Cl	CH ₃	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	J	H	CH ₃	CH ₃	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	J	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	H	J	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	J	H	30
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃	J	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	J	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃	J	H	
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	C ₂ H ₅	J	H	40
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H	J	CH ₃	
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃	H	J	
-O-(CH ₂) ₃ -	J	H	H	CH ₃	

A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -		H	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -		H	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -		C ₂ H ₅	H	H
-O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -		C ₂ H ₅	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -		CH ₃	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -		C ₂ H ₅	Cl	H
-O-(CH ₂) ₃ -		Cl	CH ₃	H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	H		H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	H		H
-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	CH ₃		H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	CH ₃		H
-O-(CH ₂) ₃ -	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅		H

A-B	X	W	Y	Z
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	CH ₃		H
-O-(CH ₂) ₃ -	Cl	C ₂ H ₅		H

【0080】

式(IId)、式(IIf)、式(IIf)、式(IId)及び式(IIf)の作物植物の適合性を改善する化合物(「除草剤薬害軽減剤(herbicide safener)」)に関連して上記で挙げた基の好ましい定義について、以下に記載する。 10

【0081】

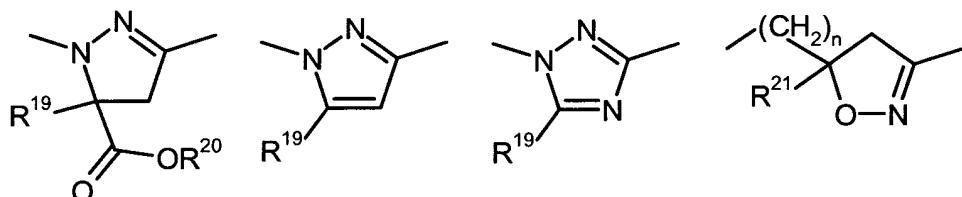
mは、好ましくは、数0、1、2、3又は4を表す。

【0082】

A¹は、好ましくは、以下に示されている2価ヘテロ環式基

【0083】

【化40】



20

のうちの1つを表す。

【0084】

nは、好ましくは、数0、1、2、3又は4を表す。

【0085】

A²は、好ましくは、それぞれメチル、エチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル又はアリルオキシカルボニルで置換されていてもよいメチレン又はエチレンを表す。 30

【0086】

R^{1~4}は、好ましくは、ヒドロキシリ、メルカプト、アミノ、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、i-プロポキシ、n-ブトキシ、i-ブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、i-プロピルチオ、n-ブチルチオ、i-ブチルチオ、s-ブチルチオ、t-ブチルチオ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、i-プロピルアミノ、n-ブチルアミノ、i-ブチルアミノ、s-ブチルアミノ、t-ブチルアミノ、ジメチルアミノ又はジエチルアミノを表す。

【0087】

R^{1~5}は、好ましくは、ヒドロキシリ、メルカプト、アミノ、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、i-プロポキシ、n-ブトキシ、i-ブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシ、1-メチルヘキシリオキシ、アリルオキシ、1-アリルオキシメチルエトキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、i-プロピルチオ、n-ブチルチオ、i-ブチルチオ、s-ブチルチオ、t-ブチルチオ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、i-プロピルアミノ、n-ブチルアミノ、i-ブチルアミノ、s-ブチルアミノ、t-ブチルアミノ、ジメチルアミノ又はジエチルアミノを表す。 40

【0088】

R^{1~6}は、好ましくは、それぞれフッ素、塩素及び/又は臭素で置換されていてもよいメチル、エチル、n-プロピル又はi-プロピルを表す。

【0089】

50

R¹⁷は、好ましくは、水素を表すか、又は、それぞれフッ素及び／若しくは塩素で置換されていてもよいメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、プロペニル、ブテニル、プロピニル、ブチニル、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、ジオキソラニルメチル、フリル、フリルメチル、チエニル、チアゾリル若しくはピペリジニルを表すか、又は、フッ素、塩素、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル若しくはt-ブチルで置換されていてもよいフェニルを表す。

【0090】

R¹⁸は、好ましくは、水素を表すか、又は、それぞれフッ素及び／若しくは塩素で置換されていてもよいメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、プロペニル、ブテニル、プロピニル、ブチニル、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、ジオキソラニルメチル、フリル、フリルメチル、チエニル、チアゾリル若しくはピペリジニルを表すか、又は、フッ素、塩素、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル若しくはt-ブチルで置換されていてもよいフェニルを表すか、又は、R¹⁷と一緒になって、基-CH₂-O-CH₂-CH₂-及び-CH₂-CH₂-O-CH₂-CH₂-〔ここで、これらは、メチル、エチル、フリル、フェニル若しくは縮合ベンゼン環で置換されていてもよいか、又は、2つの置換基（該2つの置換基は、それらが結合しているC原子と一緒に5員又は6員の炭素環を形成している。）で置換されていてもよい。〕のうちの1つを表す。

10

【0091】

R¹⁹は、好ましくは、水素、シアノ、フッ素、塩素若しくは臭素を表すか、又は、それぞれフッ素、塩素及び／若しくは臭素で置換されていてもよいメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリ若しくはフェニルを表す。

【0092】

R²⁰は、好ましくは、水素を表すか、又は、それぞれヒドロキシル、シアノ、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ若しくはi-プロポキシで置換されていてもよいメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル若しくはt-ブチルを表す。

20

【0093】

R²¹は、好ましくは、水素、シアノ、フッ素、塩素若しくは臭素を表すか、又は、それぞれフッ素、塩素及び／若しくは臭素で置換されていてもよいメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリ若しくはフェニルを表す。

【0094】

X¹は、好ましくは、ニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、i-プロポキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシを表す。

40

【0095】

X²は、好ましくは、水素、ニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、i-プロポキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシを表す。

【0096】

X³は、好ましくは、水素、ニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、ジフ

50

ルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、n - プロポキシ、i - プロポキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシを表す。

【 0 0 9 7 】

t は、好ましくは、数 0、1、2、3 又は 4 を表す。

【 0 0 9 8 】

v は、好ましくは、数 0、1、2、3 又は 4 を表す。

【 0 0 9 9 】

R²⁻² は、好ましくは、水素、メチル、エチル、n - プロピル又は i - プロピルを表す。
10

【 0 1 0 0 】

R²⁻³ は、好ましくは、水素、メチル、エチル、n - プロピル又は i - プロピルを表す。
。

【 0 1 0 1 】

R²⁻⁴ は、好ましくは、水素を表すか、又は、それぞれシアノ、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシ、n - プロポキシ若しくは i - プロポキシで置換されてもよいメチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - ブチル、i - ブチル、s - ブチル、t - ブチル、メトキシ、エトキシ、n - プロポキシ、i - プロポキシ、n - ブトキシ、i - ブトキシ、s - ブトキシ、t - ブトキシ、メチルチオ、エチルチオ、n - プロピルチオ、i - プロピルチオ、n - ブチルチオ、i - ブチルチオ、s - ブチルチオ、t - ブチルチオ、メチルアミノ、エチルアミノ、n - プロピルアミノ、i - プロピルアミノ、n - ブチルアミノ、i - ブチルアミノ、s - ブチルアミノ、t - ブチルアミノ、ジメチルアミノ若しくはジエチルアミノを表すか、又は、それぞれシアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、n - プロピル若しくは i - プロピルで置換されてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリ、シクロプロピルオキシ、シクロブチルオキシ、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシリオキシ、シクロプロピルチオ、シクロブチルチオ、シクロペンチルチオ、シクロヘキシリチオ、シクロプロピルアミノ、シクロブチルアミノ、シクロペンチルアミノ若しくはシクロヘキシリアミノを表す。
20

【 0 1 0 2 】

R²⁻⁵ は、好ましくは、水素を表すか、又は、それぞれシアノ、ヒドロキシル、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシ、n - プロポキシ若しくは i - プロポキシで置換されてもよいメチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - ブチル、i - ブチル若しくは s - ブチルを表すか、又は、それぞれシアノ、フッ素、塩素若しくは臭素で置換されてもよいプロペニル、ブテニル、プロピニル若しくはブチニルを表すか、又は、それぞれシアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、n - プロピル若しくは i - プロピルで置換されてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル若しくはシクロヘキシリを表す。
30

【 0 1 0 3 】

R²⁻⁶ は、好ましくは、水素を表すか、又は、それぞれシアノ、ヒドロキシル、フッ素、塩素、メトキシ、エトキシ、n - プロポキシ若しくは i - プロポキシで置換されてもよいメチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - ブチル、i - ブチル若しくは s - ブチルを表すか、又は、それぞれシアノ、フッ素、塩素若しくは臭素で置換されてもよいプロペニル、ブテニル、プロピニル若しくはブチニルを表すか、又は、それぞれシアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、n - プロピル若しくは i - プロピルで置換されてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル若しくはシクロヘキシリを表すか、又は、ニトロ、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - ブチル、i - ブチル、s - ブチル、t - ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、n - プロポキシ、i - プロポキシ、ジフルオロメトキシ若しくはトリフルオロメトキシで置換されてもよいフェニルを表すか、又は、R²⁻⁵ と一緒にになって、それぞれメチル若しくはエチルで置換されてもよいブタン - 1 , 4 -
40
50

ジイル(トリメチレン)、ペンタン-1,5-ジイル、1-オキサブタン-1,4-ジイル若しくは3-オキサベンタン-1,5-ジイルを表す。

【0104】

X^4 は、好ましくは、ニトロ、シアノ、カルボキシル、カルバモイル、ホルミル、スルファモイル、ヒドロキシル、アミノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、i-プロポキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシを表す。

【0105】

X^5 は、好ましくは、ニトロ、シアノ、カルボキシル、カルバモイル、ホルミル、スルファモイル、ヒドロキシル、アミノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、i-プロポキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシを表す。 10

【0106】

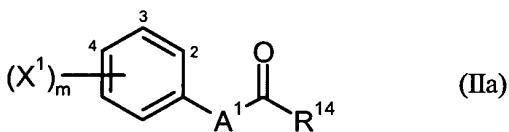
以下の表に、本発明による除草剤薬害軽減剤として特に極めて好ましい式(IIa)の化合物の例を記載する。

【0107】

【表3】

表 式(IIa)の化合物の例

20



実施例番号	(位置) (X¹)ₘ	A¹	R¹⁴
IIa-1	(2) Cl, (4) Cl		OCH₃
IIa-2	(2) Cl, (4) Cl		OC₂H₅

30

40

実施例 番号	(位置) $(X^1)_m$	A^1	R^{14}
IIa-3	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-4	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-5	(2) Cl		OCH ₃
IIa-6	(2) Cl, (4) Cl		OCH ₃
IIa-7	(2) F		OCH ₃
IIa-8	(2) F		OCH ₃

10

20

30

40

実施例 番号	(位置) $(X^1)_m$	A^1	R^{14}	
IIa-9	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅	
IIa-10	(2) Cl, (4) CF ₃		OCH ₃	10
IIa-11	(2) Cl		OCH ₃	20
IIa-12	-		OC ₂ H ₅	
IIa-13	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅	30
IIa-14	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅	
IIa-15	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅	40

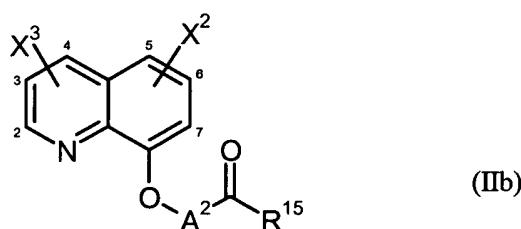
実施例 番号	(位置) $(X^1)_m$	A^1	R^{14}
IIa-16	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-17	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-18	-		OH

【0108】

以下の表に、本発明による除草剤薬害軽減剤として特に極めて好ましい式(IIb)の化合物の例を記載する。 20

【0109】

【表4】

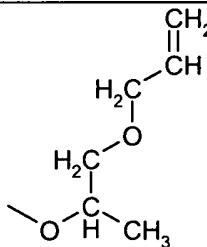
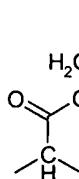


30

表 式(IIb)の化合物の例

実施例 番号	(位置) X^2	(位置) X^3	A^2	R^{15}
IIb-1	(5) Cl	-	CH ₂	OH
IIb-2	(5) Cl	-	CH ₂	OCH ₃
IIb-3	(5) Cl	-	CH ₂	OC ₂ H ₅

40

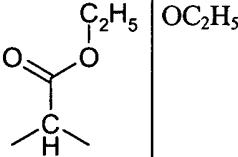
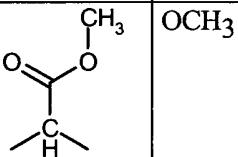
実施例番号	(位置) X²	(位置) X³	(位置) A²	(位置) R¹⁵
IIb-4	(5) Cl	-	CH ₂	OC ₃ H _{7-n}
IIb-5	(5) Cl	-	CH ₂	OC ₃ H _{7-i}
IIb-6	(5) Cl	-	CH ₂	OC ₄ H _{9-n}
IIb-7	(5) Cl	-	CH ₂	OCH(CH ₃)C ₅ H _{11-n}
IIb-8	(5) Cl	(2) F	CH ₂	OH
IIb-9	(5) Cl	(2) Cl	CH ₂	OH
IIb-10	(5) Cl	-	CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂
IIb-11	(5) Cl	-	CH ₂	OC ₄ H _{9-i}
IIb-12	(5) Cl	-	CH ₂	
IIb-13	(5) Cl	-		OCH ₂ CH=CH ₂

10

20

30

40

実施例 番号	(位置) X²	(位置) X³	A²	R¹⁵
IIb-14	(5) Cl	-		OC ₂ H ₅
IIb-15	(5) Cl	-		OCH ₃

10

【0110】

以下の表に、本発明による除草剤薬害軽減剤として特に極めて好ましい式(IIc)の化合物の例を記載する。

20

【0111】

【表5】

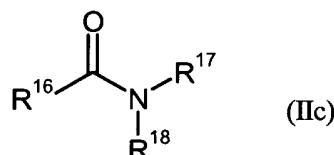
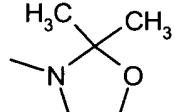
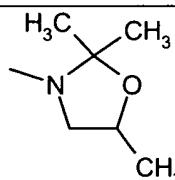


表 式(IIc)の化合物の例

30

実施例 番号	R¹⁶	N(R¹⁷,R¹⁸)
IIc-1	CHCl ₂	N(CH ₂ CH=CH ₂) ₂
IIc-2	CHCl ₂	
IIc-3	CHCl ₂	

40

実施例 番号	\mathbf{R}^{16}	$\mathbf{N}(\mathbf{R}^{17}, \mathbf{R}^{18})$
IIc-4	CHCl ₂	
IIc-5	CHCl ₂	
IIc-6	CHCl ₂	
IIc-7	CHCl ₂	

【0112】

以下の表に、本発明による除草剤薬害軽減剤として特に極めて好ましい式(IIId)の化合物の例を記載する。

【0113】

【表6】

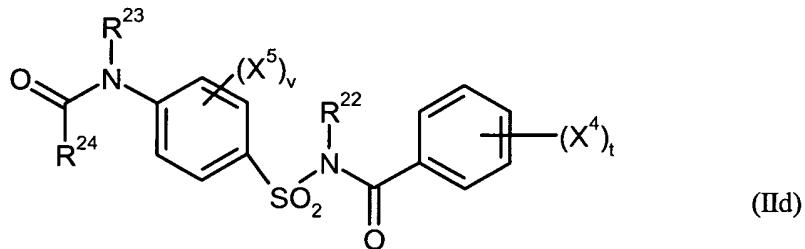


表 式(IIId)の化合物の例

実施例 番号	\mathbf{R}^{22}	\mathbf{R}^{23}	\mathbf{R}^{24}	(位置) $(\mathbf{X}^4)_t$	(位置) $(\mathbf{X}^5)_v$
IId-1	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃	-
IId-2	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃	-
IId-3	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃	-
IId-4	H	H	C ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃	-
IId-5	H	H		(2) OCH ₃	-
IId-6	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-7	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-8	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-9	H	H	C ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-10	H	H		(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-11	H	H	OCH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-12	H	H	OC ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-

10

20

30

40

実施例 番号	\mathbf{R}^{22}	\mathbf{R}^{23}	\mathbf{R}^{24}	(位置) $(\mathbf{X}^4)_t$	(位置) $(\mathbf{X}^5)_v$
IIId-13	H	H	$\text{OC}_3\text{H}_7\text{-i}$	(2) OCH_3 (5) CH_3	-
IIId-14	H	H	SCH_3	(2) OCH_3 (5) CH_3	-
IIId-15	H	H	SC_2H_5	(2) OCH_3 (5) CH_3	-
IIId-16	H	H	$\text{SC}_3\text{H}_7\text{-i}$	(2) OCH_3 (5) CH_3	-
IIId-17	H	H	NHCH_3	(2) OCH_3 (5) CH_3	-
IIId-18	H	H	NHC_2H_5	(2) OCH_3 (5) CH_3	-
IIId-19	H	H	$\text{NHC}_3\text{H}_7\text{-i}$	(2) OCH_3 (5) CH_3	-
IIId-20	H	H		(2) OCH_3 (5) CH_3	-
IIId-21	H	H	NHCH_3	(2) OCH_3	-
IIId-22	H	H	$\text{NHC}_3\text{H}_7\text{-i}$	(2) OCH_3	-
IIId-23	H	H	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	(2) OCH_3	-

10

20

30

40

実施例 番号	\mathbf{R}^{22}	\mathbf{R}^{23}	\mathbf{R}^{24}	(位置) $(\mathbf{X}^4)_t$	(位置) $(\mathbf{X}^5)_v$
IId-24	H	H	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	(3) CH_3 (4) CH_3	-
IId-25	H	H	$\text{CH}_2\text{-O-CH}_3$	(2) OCH_3	-

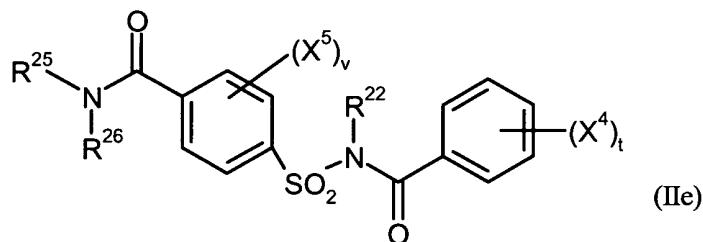
10

【0114】

以下の表に、本発明による除草剤薬害軽減剤として特に極めて好ましい式(IIe)の化合物の例を記載する。

【0115】

【表7】



20

表 式(IIe)の化合物の例

実施例 番号	\mathbf{R}^{22}	\mathbf{R}^{25}	\mathbf{R}^{26}	(位置) $(\mathbf{X}^4)_t$	(位置) $(\mathbf{X}^5)_v$
IIe-1	H	H	CH_3	(2) OCH_3	-
IIe-2	H	H	C_2H_5	(2) OCH_3	-
IIe-3	H	H	C_3H_{7-n}	(2) OCH_3	-
IIe-4	H	H	C_3H_{7-i}	(2) OCH_3	-
IIe-5	H	H	△ (cyclopropyl group)	(2) OCH_3	-
IIe-6	H	CH_3	CH_3	(2) OCH_3	-

30

40

実施例 番号	\mathbf{R}^{22}	\mathbf{R}^{25}	\mathbf{R}^{26}	(位置) $(\mathbf{X}^4)_t$	(位置) $(\mathbf{X}^5)_v$
IIe-7	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIe-8	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIe-9	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIe-10	H	H	C ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIe-11	H	H		(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIe-12	H	CH ₃	CH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-

【0116】

作物植物の適合性を改善する化合物 [成分(b')]として最も好ましいものは、クロキントセット-メキシル、フェンクロラゾール-エチル、イソキサジフェン-エチル、メフェンピル-ジエチル、フリラゾール、フェンクロリム、クミルロン、ダイムロン、ジメピレート、並びに、化合物IIe-5及び化合物IIe-11であり、クロキントセット-メキシル及びメフェンピル-ジエチルは、特に重要である。

【0117】

本発明により薬害軽減剤として使用される一般式(IIa)の化合物は、公知であり、及び/又は、自体公知の方法で調製することができる(cf. WO-A-91/07874, WO-A-95/07897)。

本発明により薬害軽減剤として使用される一般式(IIb)の化合物は、公知であり、及び/又は、自体公知の方法で調製することができる(cf. EP-A-191736)。

本発明により薬害軽減剤として使用される一般式(IIc)の化合物は、公知であり、及び/又は、自体公知の方法で調製することができる(cf. DE-A-2218097, DE-A-2350547)。

本発明により薬害軽減剤として使用される一般式(IId)の化合物は、公知であり、及び/又は、自体公知の方法で調製することができる(cf. DE-A-19621522/US-A-6235680)。

本発明により薬害軽減剤として使用される一般式(IIe)の化合物は、公知であり、

10

20

30

40

50

及び／又は、自体公知の方法で調製することができる（cf. WO-A-99/66795/US-A-6251827）。

それぞれ式（I）の1種類の活性化合物及びそれ上記で定義されている薬害軽減剤のうちの1種類を含んでいる、本発明の選択性除草剤組合せの例を、以下の表に記載する。

【0118】

【表 8】

表： 本発明による組合せの例

式 (I) の活性化合物	薬害軽減剤
I - 1 - a	クロキントセットメキシル
I - 1 - a	フェンクロラゾールエチル
I - 1 - a	イソキサジフェンエチル
I - 1 - a	メフェンピルージエチル
I - 1 - a	フリラゾール
I - 1 - a	フェンクロリム
I - 1 - a	クミルロン
I - 1 - a	ダイムロン
I - 1 - a	ジメピペレート
I - 1 - a	I I e - 1 1
I - 1 - a	I I e - 5
I - 1 - b	クロキントセットメキシル
I - 1 - b	フェンクロラゾールエチル
I - 1 - b	イソキサジフェンエチル
I - 1 - b	メフェンピルージエチル
I - 1 - b	フリラゾール
I - 1 - b	フェンクロリム
I - 1 - b	クミルロン
I - 1 - b	ダイムロン
I - 1 - b	ジメピペレート
I - 1 - b	I I e - 1 1
I - 1 - b	I I e - 5
I - 1 - c	クロキントセットメキシル
I - 1 - c	フェンクロラゾールエチル
I - 1 - c	イソキサジフェンエチル
I - 1 - c	メフェンピルージエチル
I - 1 - c	フリラゾール
I - 1 - c	フェンクロリム
I - 1 - c	クミルロン
I - 1 - c	ダイムロン
I - 1 - c	ジメピペレート
I - 1 - c	I I e - 5
I - 1 - c	I I e - 1 1
I - 1 - d	クロキントセットメキシル
I - 1 - d	フェンクロラゾールエチル
I - 1 - d	イソキサジフェンエチル
I - 1 - d	メフェンピルージエチル
I - 1 - d	フリラゾール
I - 1 - d	フェンクロリム
I - 1 - d	クミルロン
I - 1 - d	ダイムロン
I - 1 - d	ジメピペレート
I - 1 - d	I I e - 1 1
I - 1 - d	I I e - 5

10

20

30

40

式 (I) の活性化合物	薬害軽減剤	
I - 1 - e	クロキントセットーメキシル	
I - 1 - e	フェンクロラゾールーエチル	
I - 1 - e	イソキサジフェンーエチル	
I - 1 - e	メフェンピルージエチル	
I - 1 - e	フリラゾール	
I - 1 - e	フェンクロリム	
I - 1 - e	クミルロン	10
I - 1 - e	ダイムロン	
I - 1 - e	ジメピペレート	
I - 1 - e	I I e - 5	
I - 1 - e	I I e - 1 1	
I - 1 - f	クロキントセットーメキシル	
I - 1 - f	フェンクロラゾールーエチル	
I - 1 - f	イソキサジフェンーエチル	
I - 1 - f	メフェンピルージエチル	
I - 1 - f	フリラゾール	
I - 1 - f	フェンクロリム	
I - 1 - f	クミルロン	
I - 1 - f	ダイムロン	
I - 1 - f	ジメピペレート	20
I - 1 - f	I I e - 5	
I - 1 - f	I I e - 1 1	
I - 1 - g	クロキントセットーメキシル	
I - 1 - g	フェンクロラゾールーエチル	
I - 1 - g	イソキサジフェンーエチル	
I - 1 - g	メフェンピルージエチル	
I - 1 - g	フリラゾール	
I - 1 - g	フェンクロリム	
I - 1 - g	クミルロン	
I - 1 - g	ダイムロン	
I - 1 - g	ジメピペレート	30
I - 1 - g	I I e - 5	
I - 1 - g	I I e - 1 1	
I - 2 - a	クロキントセットーメキシル	
I - 2 - a	フェンクロラゾールーエチル	
I - 2 - a	イソキサジフェンーエチル	
I - 2 - a	メフェンピルージエチル	
I - 2 - a	フリラゾール	
I - 2 - a	フェンクロリム	
I - 2 - a	クミルロン	
I - 2 - a	ダイムロン	
I - 2 - a	ジメピペレート	40
I - 2 - a	I I e - 5	
I - 2 - a	I I e - 1 1	

式 (I) の活性化合物	薬害軽減剤
I - 2 - b	クロキントセットーメキシル
I - 2 - b	フェンクロラゾールーエチル
I - 2 - b	イソキサジフェンーエチル
I - 2 - b	メフェンピルージエチル
I - 2 - b	フリラゾール
I - 2 - b	フェンクロリム
I - 2 - b	クミルロン
I - 2 - b	ダイムロン
I - 2 - b	ジメピペレート
I - 2 - b	I I e - 5
I - 2 - b	I I e - 1 1
I - 2 - c	クロキントセットーメキシル
I - 2 - c	フェンクロラゾールーエチル
I - 2 - c	イソキサジフェンーエチル
I - 2 - c	メフェンピルージエチル
I - 2 - c	フリラゾール
I - 2 - c	フェンクロリム
I - 2 - c	クミルロン
I - 2 - c	ダイムロン
I - 2 - c	ジメピペレート
I - 2 - c	I I e - 5
I - 2 - c	I I e - 1 1
I - 2 - d	クロキントセットーメキシル
I - 2 - d	フェンクロラゾールーエチル
I - 2 - d	イソキサジフェンーエチル
I - 2 - d	メフェンピルージエチル
I - 2 - d	フリラゾール
I - 2 - d	フェンクロリム
I - 2 - d	クミルロン
I - 2 - d	ダイムロン
I - 2 - d	ジメピペレート
I - 2 - d	I I e - 5
I - 2 - d	I I e - 1 1
I - 2 - e	クロキントセットーメキシル
I - 2 - e	フェンクロラゾールーエチル
I - 2 - e	イソキサジフェンーエチル
I - 2 - e	メフェンピルージエチル
I - 2 - e	フリラゾール
I - 2 - e	フェンクロリム
I - 2 - e	クミルロン
I - 2 - e	ダイムロン
I - 2 - e	ジメピペレート
I - 2 - e	I I e - 5
I - 2 - e	I I e - 1 1

10

20

30

40

式 (I) の活性化合物	薬害軽減剤	
I - 2 - f	クロキントセットーメキシル	
I - 2 - f	フェンクロラゾールーエチル	
I - 2 - f	イソキサジフェンーエチル	
I - 2 - f	メフェンピルージエチル	
I - 2 - f	フリラゾール	
I - 2 - f	フェンクロリム	
I - 2 - f	クミルロン	
I - 2 - f	ダイムロン	
I - 2 - f	ジメピペレート	10
I - 2 - f	II e - 5	
I - 2 - f	II e - 11	
I - 2 - g	クロキントセットーメキシル	
I - 2 - g	フェンクロラゾールーエチル	
I - 2 - g	イソキサジフェンーエチル	
I - 2 - g	メフェンピルージエチル	
I - 2 - g	フリラゾール	
I - 2 - g	フェンクロリム	
I - 2 - g	クミルロン	
I - 2 - g	ダイムロン	
I - 2 - g	ジメピペレート	20
I - 2 - g	II e - 5	
I - 2 - g	II e - 11	

【0119】

驚くべきことに、一般式 (I) の化合物と上記群 (b') から選択される薬害軽減剤 (解毒剤) からなる上記で定義された活性化合物の組合せが、特に高い除草活性を有しているながら、同時に、該組合せに対して植物は極めて良好に実用的な耐性を示すということ、及び、該組合せを、様々な作物において、特に、禾穀類 (とりわけ、コムギ) や、さらに、ダイズ、ジャガイモ、トウモロコシ及びイネにおいて、雑草を選択的に防除するために使用することができるということが見いだされた。

【0120】

これに関連して、作物植物に対する除草剤の有害な作用を打ち消すことが可能な多数の既知薬害軽減剤又は解毒剤のなかで、とりわけ上記群 (b') の化合物が、雑草に対するオキサスピロ環式スピロ置換テトラミン酸及びテトロン酸誘導体の除草活性に重大な悪影響を及ぼすことなく、同時に、作物植物に対するそのオキサスピロ環式スピロ置換テトラミン酸及びテトロン酸誘導体の有害な作用を (殆ど完全に) 補償するのに適しているということは、驚くべきものであると思われる。

【0121】

作物植物としての禾穀類植物、例えば、コムギ、オオムギ及びライムギや、さらに、トウモロコシ及びイネなどに対する穏やかな処理に特に関連して、群 (b') から選択される特に好ましい組合せ相手及び最も好ましい組合せ相手が有する特に有利な効果は、本発明において重要であり得る。

【0122】

アンモニウム塩を添加することによってさまざまな活性化合物の効果がどのように増強され得るのかということについては、文献中に既に記載されている。しかしながら、当該塩は、洗浄効果を有するする塩 (例えば、WO 95/017817) であるか、又は、比較的長いアルキル置換基及び / 若しくはアリール置換基を有していて、浸透効果を有するか若しくは活性化合物の溶解性を増大させる塩 (例えば、EP-A 0453086、EP-A 0664081、FR-A 2600494、US 4844734、US 5462912、US 5538937、US-A 03/0224939、US-A 05/0009880、US-A 05/0096386) である。さらにまた、従来技術で記載されているのは、特定の活性化合物及び / 又は対応する組成物の特定の施用についての効果のみである。別の場合においては、

30

40

50

当該塩は、その酸自体が昆虫に対する麻痺作用を示すスルホン酸の塩である(US 2842476)。例えば、硫酸アンモニウムによって作用が増強されることは、一例として、除草剤のグリホセート及びホスフィノトリシンに関して、並びに、フェニル置換環状ケトエノールに関して記載されている(US 6645914、EP-A20036106、WO 07/068427)。殺虫剤の場合における作用の対応する増強については、WO 07/068428において既に記載されている。

【0123】

さらにまた、硫酸アンモニウムを製剤助剤として使用することも、特定の活性化合物及び施用に関して既に記載されている(WO 92/16108)が、そこでは、硫酸アンモニウムの目的は、製剤を安定化させることであって、作用を増強することではない。

【0124】

全く驚くべきことに、施用する溶液にアンモニウム塩若しくはホスホニウム塩を添加することによって、又は、そのような塩をオキサスピロ環式スピロ置換テトラミン酸及びテトロン酸誘導体を含んでいる製剤の中に組み入れることによって、オキサスピロ環式スピロ置換テトラミン酸及びテトロン酸誘導体の種類から選択される殺虫剤及び/又は殺ダニ剤及び/又は除草剤の作用が有意に増強され得るということが分かった。従って、本発明は、除草活性及び/又は殺虫活性及び/又は殺ダニ活性を有するオキサスピロ環式スピロ置換テトラミン酸及びテトロン酸誘導体を活性化合物として含んでいる作物保護組成物の作用を増強するための、アンモニウム塩類又はホスホニウム塩類の使用を提供する。本発明は、さらにまた、除草活性及び/又は殺ダニ活性及び/又は殺虫活性を有するオキサスピロ環式スピロ置換テトラミン酸及びテトロン酸誘導体とその作用を増強するアンモニウム塩類又はホスホニウム塩類を含んでいる組成物も提供し、ここで、そのような組成物には、製剤された活性化合物のみではなく、即時使用可能な(ready-to-use)組成物(散布液)も含まれる。最後に、本発明は、有害な昆虫類及び/又はハダニ類及び/又は望ましくない植物の生長を防除するためのそのような組成物の使用も提供する。

【0125】

式(I)の化合物は、広範な殺虫活性及び/又は殺ダニ活性及び/又は除草活性を有している。しかしながら、個別的には、その活性及び/又は植物の耐性は、まだ充分とはいえない。

【0126】

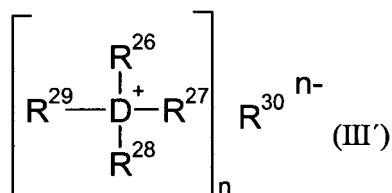
当該活性化合物は、本発明の組成物中において、広い濃度範囲で使用することが可能である。そのような製剤中における当該活性化合物の濃度は、典型的には、0.1重量%から50重量%である。

【0127】

脂肪酸合成阻害薬を含んでいる作物保護組成物の活性を本発明に従って増強するアンモニウム塩及びホスホニウム塩は、式(III')

【0128】

【化41】



によって定義され、ここで、

Dは、窒素又はリンを表し、

Dは、好ましくは、窒素を表し、

R²⁶、R²⁷、R²⁸及びR²⁹は、互いに独立して、水素を表すか、又は、それぞれ置換されていてもよいC₁-C₈-アルキル又はモノ不飽和若しくはポリ不飽和の置換されていてもよいC₁-C₈-アルキレン(該置換基は、ハロゲン、ニトロ及びシアノか

10

20

30

40

50

ら選択され得る。)を表し、

$R^{2\ 6}$ 、 $R^{2\ 7}$ 、 $R^{2\ 8}$ 及び $R^{2\ 9}$ は、互いに独立して、好ましくは、水素を表すか、又は、それぞれ置換されていてもよいC₁-C₄-アルキル(該置換基は、ハロゲン、ニトロ及びシアノから選択され得る。)を表し、

$R^{2\ 6}$ 、 $R^{2\ 7}$ 、 $R^{2\ 8}$ 及び $R^{2\ 9}$ は、互いに独立して、特に好ましくは、水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル又はtert-ブチルを表し、

$R^{2\ 6}$ 、 $R^{2\ 7}$ 、 $R^{2\ 8}$ 及び $R^{2\ 9}$ は、特に極めて好ましくは、水素を表し、

nは、1、2、3又は4を表し、

nは、好ましくは、1又は2を表し、

$R^{3\ 0}$ は、有機アニオン又は無機アニオンを表し、

$R^{3\ 0}$ は、好ましくは、炭酸水素アニオン、四ホウ酸アニオン、フッ化物アニオン、臭化物アニオン、ヨウ化物アニオン、塩化物アニオン、リン酸一水素アニオン、リン酸二水素アニオン、硫酸水素アニオン、酒石酸アニオン、硫酸アニオン、硝酸アニオン、チオ硫酸アニオン、チオシアン酸アニオン、ギ酸アニオン、乳酸アニオン、酢酸アニオン、プロピオン酸アニオン、酪酸アニオン、ペンタン酸アニオン又はシュウ酸アニオンを表し、

$R^{3\ 0}$ は、特に好ましくは、乳酸アニオン、硫酸アニオン、硝酸アニオン、チオ硫酸アニオン、チオシアン酸アニオン、シュウ酸アニオン又はギ酸アニオンを表し、

$R^{3\ 0}$ は、特に極めて好ましくは、硫酸アニオンを表す。

【0129】

10

活性化合物と塩と浸透剤の本発明において重要な組合せについては、下記表に記載してある。ここで、「試験による浸透剤(penetrant as per test)」は、クチクラ浸透性試験(Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152)において浸透剤として作用する任意の化合物が適しているということを意味する。

【0130】

20

式(I I I')のアンモニウム塩類及びホスホニウム塩類は、ケトエノール類を含んでいる作物保護組成物の活性を増強するために、広い濃度範囲で使用することができる。一般に、該アンモニウム塩類又はホスホニウム塩類は、即時使用可能な作物保護組成物中で、0.5から80mmol/L、好ましくは、0.75から37.5mmol/L、さらに好ましくは、1.5から25mmol/Lの濃度で使用する。製剤されている製品の場合、当該製剤中のアンモニウム塩及び/又はホスホニウム塩の濃度は、その製剤を所望の活性化合物濃度に希釈した後で、上記で記載した一般的な範囲、好ましい範囲又は特に好ましい範囲の中に入っているように選択する。製剤中の該塩の濃度は、典型的には、1重量%から50重量%である。

30

【0131】

本発明の好ましい一実施形態では、当該活性は、作物保護組成物にアンモニウム塩及び/又はホスホニウム塩のみを添加するのではなく、さらに浸透剤も添加することによって増強する。このような場合においてさえ、さらに大幅な活性の増強が観察されるということは、全く驚くべきことであると考えられる。従って、本発明は、さらに、殺虫活性を有するオキサスピロ環式スピロ置換テトラミン酸及びテトロン酸誘導体を活性化合物として含んでいる作物保護組成物の活性を増強するための、浸透剤とアンモニウム塩類及び/又はホスホニウム塩類の組合せの使用も提供する。本発明は、さらに、除草活性及び/又は殺ダニ活性及び/又は殺虫活性を有するオキサスピロ環式スピロ置換テトラミン酸及びテトロン酸誘導体と浸透剤とアンモニウム塩類及び/又はホスホニウム塩類を含んでいる組成物も提供し、ここで、そのような組成物には、特に、製剤された活性化合物のみではなく、即時使用可能な組成物(散布液)も含まれる。本発明は、最後に、さらに、有害な昆虫類を防除するためのそのような組成物の使用も提供する。

40

【0132】

本発明に関連して、適切な浸透剤には、植物中への農薬活性化合物の浸透を向上させるために一般的に使用される全ての物質が包含される。これに関連して、浸透剤は、水性散

50

布液から及び / 又は散布による被膜から植物のクチクラ中に浸透する能力、及び、それによって、活性化合物のクチクラ内での移動性を増強する能力によって定義される。この特性を確認するためには、文献 (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) に記載されている方法を用いることができる。

【0133】

適切な浸透剤の例としては、アルカノールアルコキシレート類を挙げることができる。
本発明による浸透剤は、式 (IV')

【0134】

【化42】



10

[式中、

R は、4 から 20 個の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖のアルキルであり；

R' は、水素、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、tert-ブチル、n - ペンチル又はn - ヘキシルであり；

A O は、エチレンオキシド基、プロピレンオキシド基若しくはブチレンオキシド基であるか、又は、エチレンオキシドとプロピレンオキシド基若しくはブチレンオキシド基の混合物であり；及び、

v は、2 から 30 の数である。]

20

のアルカノールアルコキシレート類である。

【0135】

浸透剤の好ましい一群は、式

【0136】

【化43】



[式中、

R は、上記で定義されているとおりであり；

30

R' は、上記で定義されているとおりであり；

E O は、- C H₂ - C H₂ - O - であり；及び、

n は、2 から 20 の数である。]

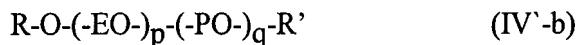
のアルカノールアルコキシレート類である。

【0137】

浸透剤の好ましいさらに別の群は、式

【0138】

【化44】



40

[式中、

R は、上記で定義されているとおりであり；

R' は、上記で定義されているとおりであり；

E O は、- C H₂ - C H₂ - O - であり；

P O は、- C H₂ - C H (C H₃) - O - であり；

p は、1 から 10 の数であり；及び、

q は、1 から 10 の数である。]

のアルカノールアルコキシレート類である。

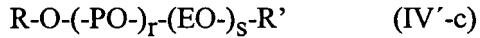
【0139】

50

浸透剤の好ましいさらに別の群は、式

【0140】

【化45】



[式中、

Rは、上記で定義されているとおりであり；

R'は、上記で定義されているとおりであり；

E Oは、-CH₂-CH₂-O-であり；

10

P Oは、-CH₂-CH(CH₃)-O-であり；

rは、1から10の数であり；及び、

sは、1から10の数である。】

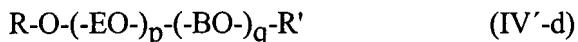
のアルカノールアルコキシレート類である。

【0141】

浸透剤の好ましいさらに別の群は、式

【0142】

【化46】



20

[式中、

R及びR'は、上記で定義されているとおりであり；

E Oは、CH₂-CH₂-O-であり；

B Oは、-CH₂-CH₂-CH(CH₃)-O-であり；

pは、1から10の数であり；及び、

qは、1から10の数である。】

のアルカノールアルコキシレート類である。

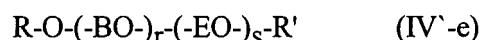
【0143】

浸透剤の好ましいさらに別の群は、式

30

【0144】

【化47】



[式中、

R及びR'は、上記で定義されているとおりであり；

B Oは、-CH₂-CH₂-CH(CH₃)-O-であり；

E Oは、CH₂-CH₂-O-であり；

rは、1から10の数であり；及び、

40

sは、1から10の数である。】

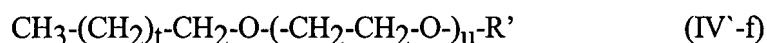
のアルカノールアルコキシレート類である。

【0145】

浸透剤の好ましいさらに別の群は、式

【0146】

【化48】



[式中、

50

R'は、上記で定義されているとおりであり；
tは、8から13の数であり；
uは、6から17の数である。]
のアルカノールアルコキシレート類である。

【0147】

上記で示されている式において、Rは、好ましくは、ブチル、イソブチル、n-ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、n-ヘキシル、イソヘキシル、n-オクチル、イソオクチル、2-エチルヘキシル、ノニル、イソノニル、デシル、n-ドデシル、イソドデシル、ラウリル、ミリスチル、イソトリデシル、トリメチルノニル、パルミチル、ステアリル又はエイコシルである。

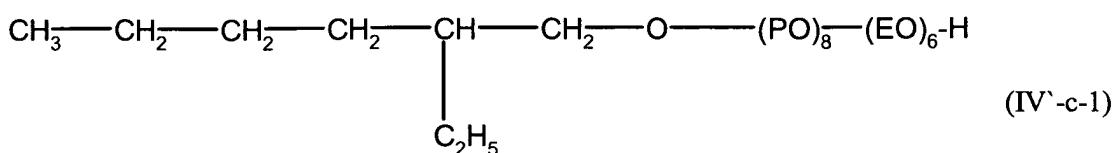
10

【0148】

式(IV'-c)のアルカノールアルコキシレートの例としては、式

【0149】

【化49】



[式中、

20

E Oは、-CH₂-CH₂-O-であり；
P Oは、-CH₂-CH(CH₃)-O-であり；及び、
数8及び6は、平均値を表している。]

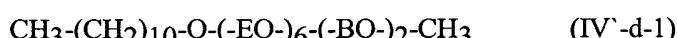
の2-エチルヘキシルアルコキシレートを挙げることができる。

【0150】

式(IV'-d)のアルカノールアルコキシレートの例としては、式

【0151】

【化50】



30

[式中、

E Oは、CH₂-CH₂-O-であり；
B Oは、-CH₂-CH₂-CH(CH₃)-O-であり；及び、
数10、6及び2は、平均値を表している。]

を挙げることができる。

【0152】

式(IV'-f)の特に好ましいアルカノールアルコキシレート類は、式中、

tが、9から12の数であり；及び

uが、7から9の数である

40

当該式の化合物である。

【0153】

式(IV'-f-1)

【0154】

【化51】



[式中、

tは、平均値10.5を表し、

50

μ は、平均値 8 . 4 表す。]

のアルカノールアルコキシレートを、特に極めて好ましいものとして挙げることができる。

【 0 1 5 5 】

当該アルカノールアルコキシレート類の一般的な定義は、上記式によって与えられる。これらの物質は、異なった鎖長を有する上記タイプの化合物の混合物である。従って、添え字は、平均値であって、整数とは異なることもあり得る。

【 0 1 5 6 】

上記式のアルカノールアルコキシレート類は、既知であり、場合によっては、商業的に入手可能であるか又は既知方法で調製可能である (cf. WO 98/35553, WO 00/35278 及び EP-A 0681865)。

10

【 0 1 5 7 】

適切な浸透剤には、さらにまた、例えば、散布による被膜の中の式 (I) の化合物の有用性を増進する物質も包含される。そのようなものとしては、例えば、鉛油及び植物油などがある。適切な油は、農薬組成物中で一般的に使用可能な全ての鉛油又は植物油 (変性されているか又は変性されていない。) である。ヒマワリ油、ナタネ油 (rapeseed oil) 、オリーブ油、ヒマシ油、ナタネ油 (colza oil) 、トウモロコシ油 (maize seed oil) 、綿実油及びダイズ油、又は、前記油のエステル類を、例として挙げることができる。ナタネ油 (rapeseed oil) 、ヒマワリ油及びそれらのメチルエステル又はエチルエステルが好ましい。

20

【 0 1 5 8 】

本発明組成物中の浸透剤の濃度は、広い範囲内でさまざまであることができる。製剤された作物保護組成物の場合、該濃度は、一般に、1から95重量%、好ましくは、1から55重量%、さらに好ましくは、15から40重量%である。即時使用可能な組成物（散布液）中においては、該濃度は、一般に、0.1から10g/L、好ましくは、0.5から5g/Lである。

【 0 1 5 9 】

本発明の作物保護組成物には、さらなる成分、例えば、界面活性剤及び／又は分散助剤又は乳化剤なども含ませることができる。

【 0 1 6 0 】

30

適切な非イオン性界面活性剤及び／又は分散助剤には、農薬組成物中で一般的に使用可能なこのタイプの全ての物質が包含される。ポリエチレンオキシド - ポリプロピレンオキシドブロックコポリマー、直鎖アルコールのポリエチレングリコールエーテル、脂肪酸とエチレンオキシド及び／又はプロピレンオキシドの反応生成物を好ましいものとして挙げることができ、さらにまた、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコールとポリビニルピロリドンのコポリマー及び(メタ)アクリル酸と(メタ)アクリル酸エステルのコポリマーも好ましいものとして挙げることができ、さらにまた、アルキルエトキシレート及びアルキルアリールエトキシレート(これらは、リン酸化されてもよく、また、塩基で中和されてもよく、ソルビトールエトキシレートを例として挙げができる。)も好ましいものとして挙げることができ、さらにまた、ポリオキシアルキレンアミン誘導体も好ましいものとして挙げができる。

40

【 0 1 6 1 】

適切なアニオン性界面活性剤には、農薬組成物中で一般的に使用可能なこのタイプの全ての物質が包含される。アルキルスルホン酸又はアルキルアリールスルホン酸のアルカリ金属塩及びアルカリ土類金属塩が好ましい。

【 0 1 6 2 】

アニオン性界面活性剤及び／又は分散助剤の好ましい別の群は、植物油中における溶解度が低い以下の塩である：ポリスチレンスルホン酸の塩、ポリビニルスルホン酸の塩、ナフタレンスルホン酸 - ホルムアルデヒド縮合物の塩、ナフタレンスルホン酸とフェノールスルホン酸とホルムアルデヒドの縮合物の塩、及び、リグノスルホン酸の塩。

50

【 0 1 6 3 】

本発明の製剤中に含有させ得る適切な添加剤は、乳化剤、消泡剤、防腐剤、酸化防止剤、着色剤及び不活性增量性物質(filling material)である。

[0 1 6 4]

好ましい乳化剤は、エトキシル化ノニルフェノール類、アルキルフェノールとエチレンオキシド及び／又はプロピレンオキシドの反応生成物、エトキシル化アリールアルキルフェノール類、さらにまた、エトキシル化及びプロポキシル化アリールアルキルフェノール類、並びに、硫酸化又はリン酸化アリールアルキルエトキシレート類及び／又はアリールアルキルエトキシプロポキシレート類であり、ここで、ソルビタン誘導体、例えば、ポリエチレンオキシド・ソルビタン脂肪酸エステル類及びソルビタン脂肪酸エステル類などを例として挙げることができる。

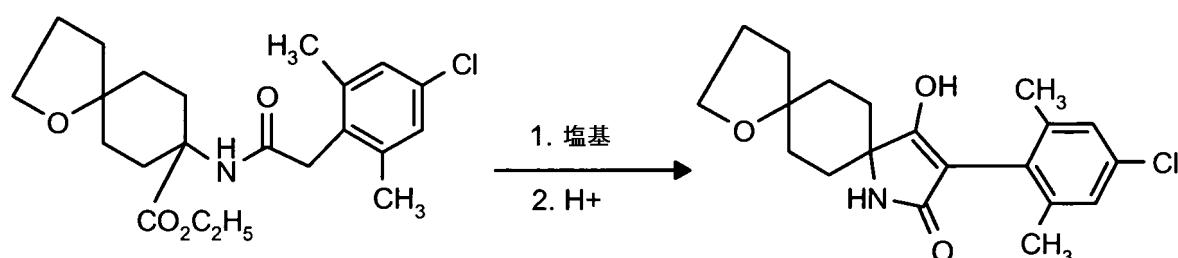
10

[0 1 6 5]

例えば、調製方法(A)に従い、N-[(4-クロロ-2,6-ジメチル)フェニルアセチル]-1-アミノ-4,4'-プロピレニルオキシシクロヘキサンカルボン酸エチルを出発物質として使用する場合、本発明の調製方法の経過は以下の反応スキームにより表すことができる。

[0 1 6 6]

【化 5 2】



20

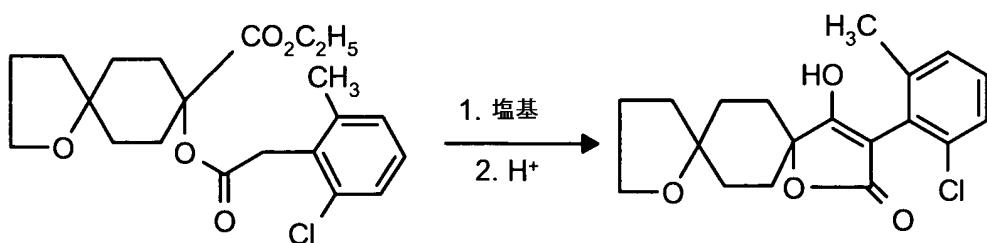
[0 1 6 7]

例えば、調製方法（B）に従い、O-[（2-クロロ-6-メチル）フェニルアセチル]-1-ヒドロキシ-4,4'-プロピレニルオキシシクロヘキサンカルボン酸エチルを使用する場合、本発明の調製方法の経過は以下の反応スキームにより表すことができる。

88

[0 1 6 8]

【化 5.3】



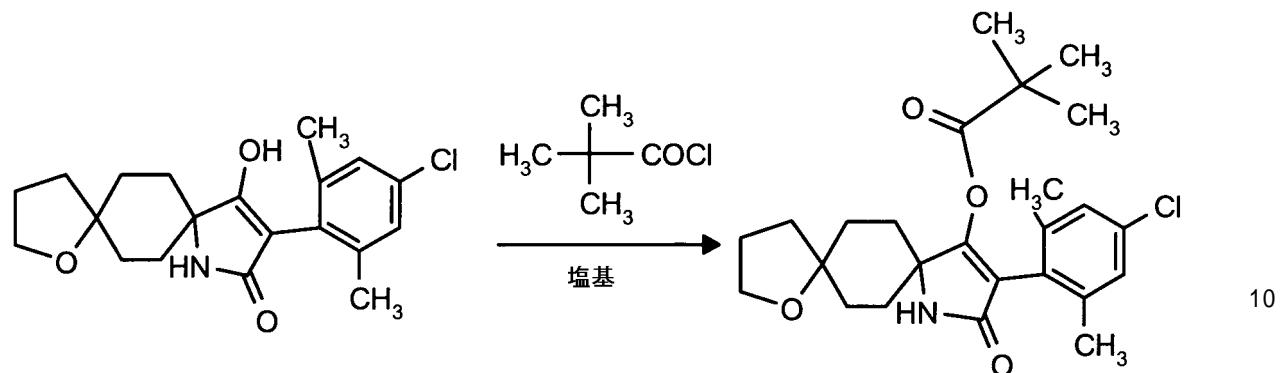
40

【 0 1 6 9 】

例えば、調製方法（C）に従い、8'，8'-プロピレンオキシ-3-[（4-クロロ-2,6-ジメチル）フェニル]-1-アザスピロ[4,5]デカン-2,4-ジオン及び塩化ピバロイルを出発物質として使用する場合、本発明の調製方法の経過は以下の反応スキームにより表すことができる。

[0 1 7 0]

【化54】



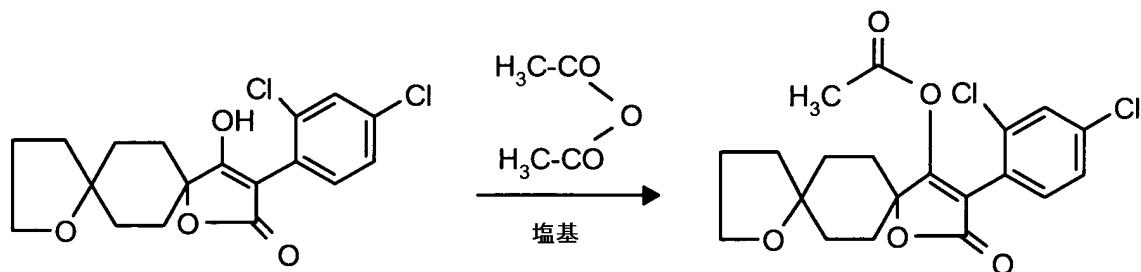
【0171】

例えば、調製方法(C)(変形態様)に従い、8,8'-(2,4-ジクロロ)フェニル]-1-オキサスピロ-[4,5]-デカン-2,4-ジオン及び無水酢酸を出発物質として使用する場合、本発明の調製方法の経過は以下の反応スキームにより表すことができる。

【0172】

【化55】

20



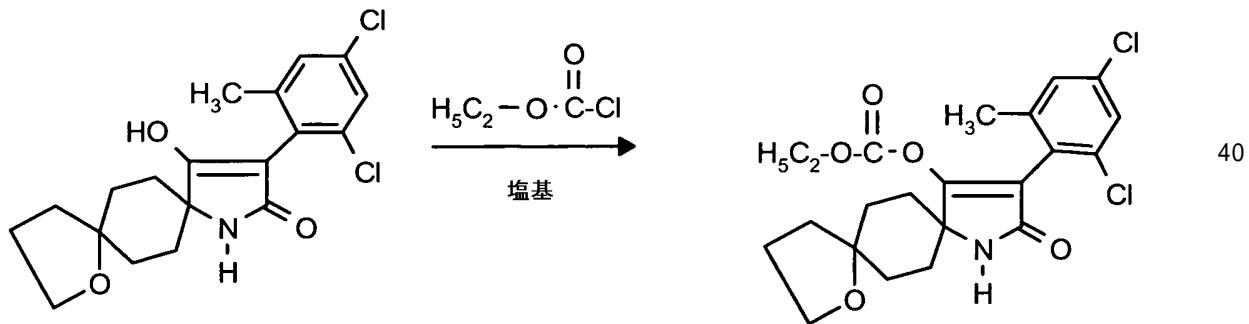
【0173】

例えば、調製方法(D)に従い、8,8'-(2,4-ジクロロ-6-メチル)フェニル]-1-アザスピロ[4,5]デカン-2,4-ジオン及びクロロギ酸エチルを出発物質として使用する場合、本発明の調製方法の経過は以下の反応スキームにより表すことができる。

30

【0174】

【化56】



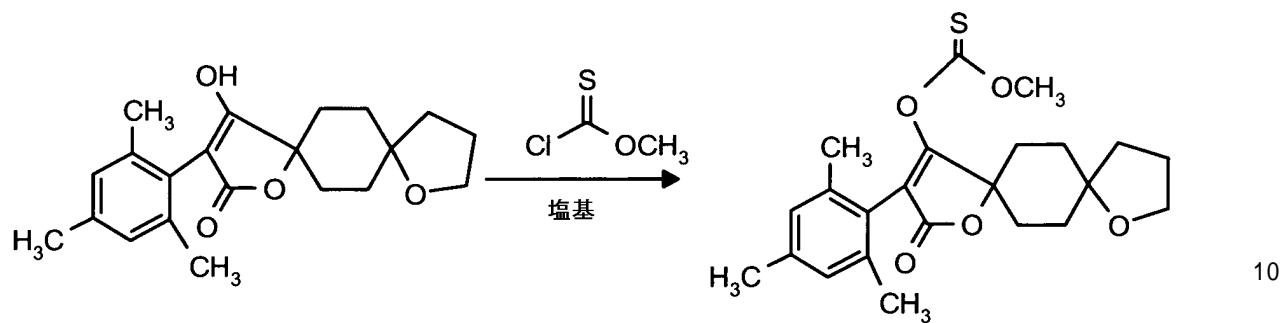
【0175】

例えば、調製方法(E)に従い、8,8'-(2,4,6-トリメチル)フェニル]-1-オキサスピロ[4,5]デカン-2,4-ジオン及びクロロモノチオギ酸メチルを出発物質として使用する場合、当該反応の経過は以下のように表すことができる。

50

【0176】

【化57】

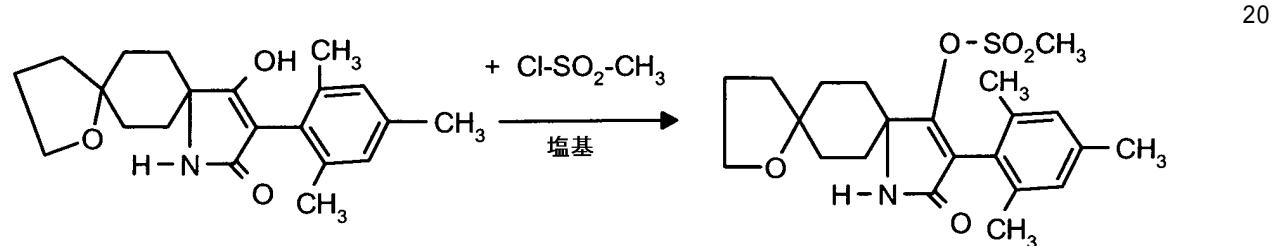


【0177】

例えれば、調製方法(F)に従い、8,8' - プロピレンオキシ - 3 - [(2,4,6 - トリメチル) フェニル] - 1 - アザスピロ [4,5] デカン - 2,4 - ジオン及び塩化メタンスルホニルを出発物質として使用する場合、当該反応の経過は以下の反応スキームにより表すことができる。

【0178】

【化58】

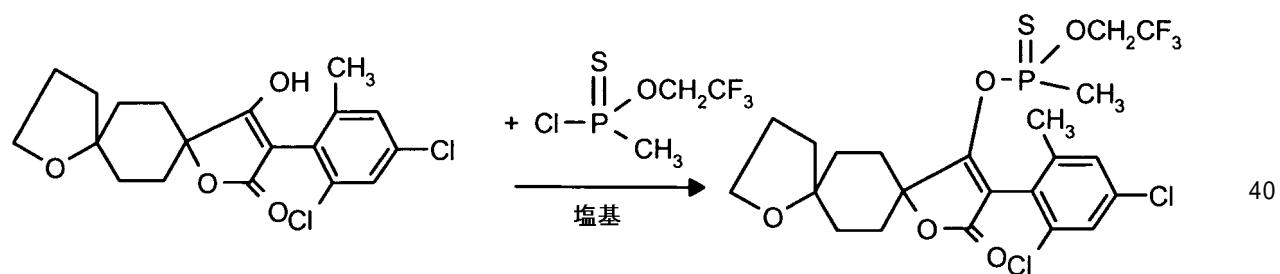


【0179】

例えれば、調製方法(G)に従い、8,8' - プロピレンオキシ - 3 - [(2,4 - ジクロロ - 6 - メチル) フェニル] - 1 - オキサスピロ [4,5] デカン - 2,4 - ジオン及び2,2,2 - トリフルオロエチルメタンチオホスホニルクロリドを出発物質として使用する場合、当該反応の経過は以下の反応スキームにより表すことができる。

【0180】

【化59】

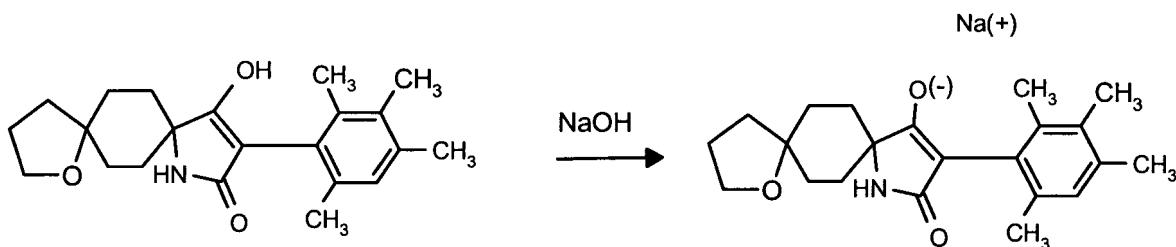


【0181】

例えれば、調製方法(H)に従い、8,8' - プロピレンオキシ - 3 - [(2,3,4,6 - テトラメチルフェニル] - 1 - アザスピロ [4,5] デカン - 2,4 - ジオン及びN a OHを成分として使用する場合、本発明の調製方法の経過は以下の反応スキームにより表すことができる。

【0182】

【化60】



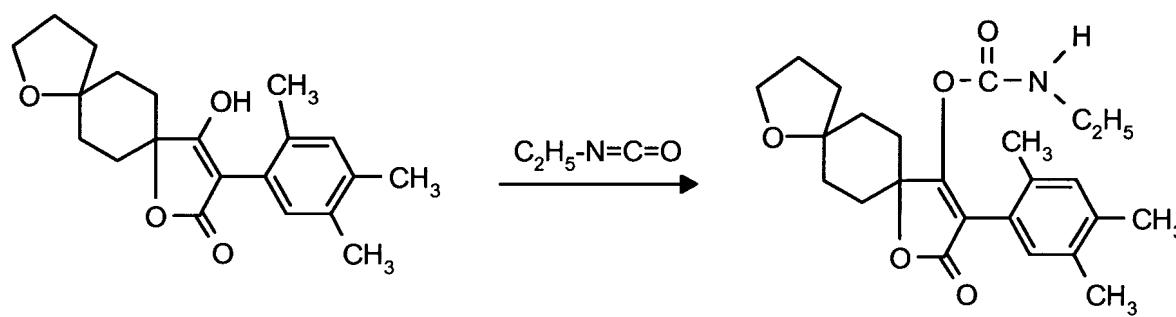
【0183】

10

例えば、調製方法(Ⅰ)(変形態様)に従い、8,8'-プロピレンオキシ-3-[
(2,4,5-トリメチル)フェニル]-1-オキサスピロ[4,5]デカン-2,4-ジオン及びイソチオシアノ酸エチルを出発物質として使用する場合、当該反応の経過は以下の反応スキームにより表すことができる。

【0184】

【化61】



20

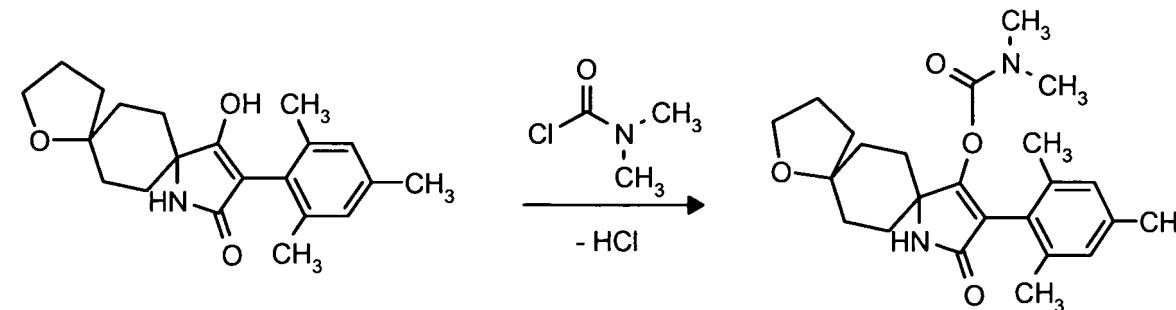
【0185】

例えば、調製方法(Ⅰ)(変形態様)に従い、8,8'-プロピレンオキシ-3-[
(2,4,6-トリメチル)フェニル]-1-アザスピロ[4,5]デカン-2,4-ジオン及びジメチルカルバモイルクロリドを出発物質として使用する場合、当該反応の経過は以下のスキームにより表すことができる。

30

【0186】

【化62】



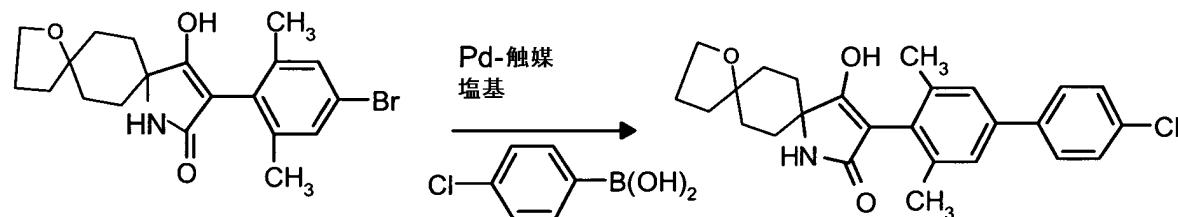
40

【0187】

例えば、調製方法(Ⅱ)に従い、8,8'-プロピレンオキシ-3-[
(4-プロモ-2,6-ジメチル-フェニル]-1-アザスピロ[4,5]デカン-2,4-ジオン及び4-クロロフェニルボロン酸を出発物質として使用する場合、当該反応の経過は以下のスキームにより表すことができる。

【0188】

【化63】



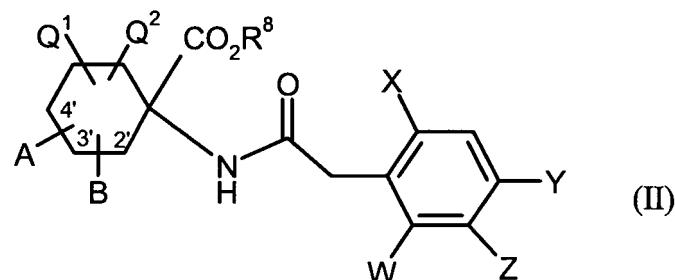
【0189】

10

本発明の調製方法(A)において出発物質として必要とされる式(II)

【0190】

【化64】



20

[式中、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z及びR⁸は、上記で与えられている意味を有する。]

の化合物は新規である。

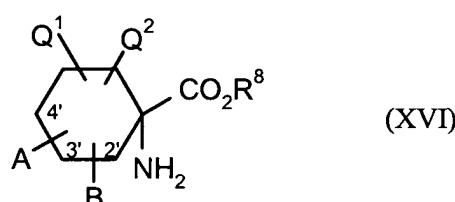
【0191】

式(II)のアシリルアミノ酸エステルは、例えば、式(XVII)

【0192】

【化65】

30



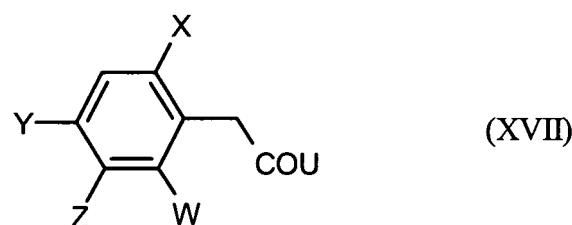
[式中、A、B、Q¹、Q²及びR⁸は、上記で与えられている意味を有する。]

のアミノ酸誘導体を、式(XVII)

【0193】

【化66】

40



[式中、

W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有し；

50

Uは、カルボン酸を活性化する試薬〔例えば、カルボニルジイミダゾール、カルボジイミド(例えば、ジシクロヘキシリカルボジイミド)、リン酸化試薬(例えば、POCl₃、BOP-CI)、ハロゲン化試薬、例えば、塩化チオニル、塩化オキサリル、ホスゲン又はクロロギ酸エステルなど〕により導入される脱離基を表す。〕

の置換フェニル酢酸誘導体を用いてアシル化すれば得られる(Chem. Reviews 52, 237-416 (1953); Bhattacharya, Indian J. Chem. 6, 341-5, 1968);

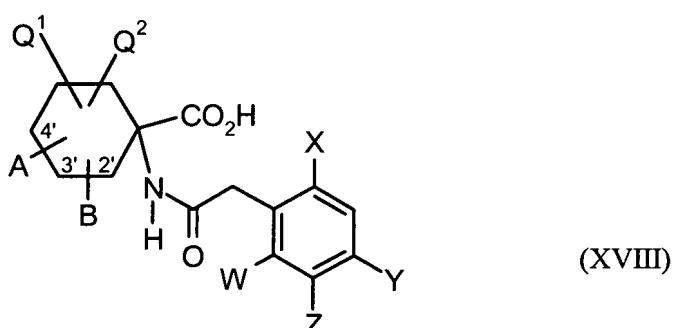
又は、

式(XVII)

【0194】

【化67】

10



20

[式中、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。]

のアシルアミノ酸をエステル化すれば得られる(Chem. Ind. (London) 1568 (1968))。

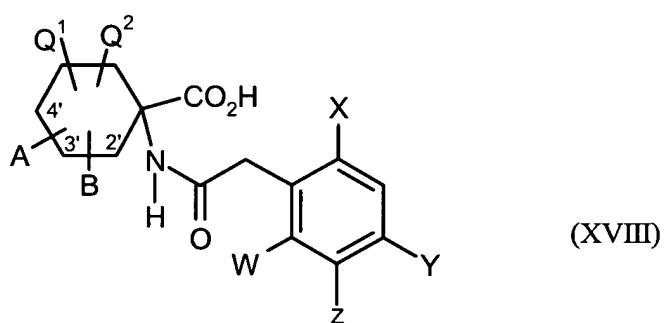
【0195】

式(XVII)

【0196】

【化68】

30



[式中、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。]

の化合物は、新規である。

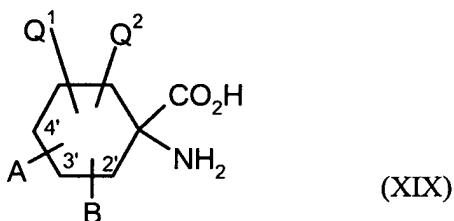
【0197】

式(XVII)の化合物は、例えば、Schotten-Baumann (Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, p.505)に従い、例えば、式(XIX):

【0198】

40

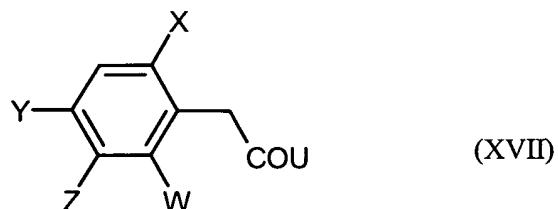
【化 6 9】



[式中、A、B、Q¹及びQ²は、上記で与えられている意味を有する。]
の1-アミノシクロヘキサンカルボン酸を、式(XVII)

【0199】

【化 7 0】



[式中、U、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。]
の置換フェニル酢酸誘導体を用いてアシル化すれば得られる。

【0200】

式(XVII)の化合物の一部は知られており、及び/又は、それらは、最初に引用した特許公開に記載されている既知調製方法によって調製することができる。

【0201】

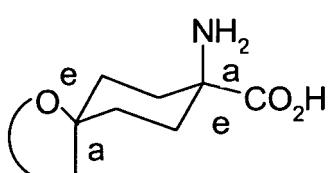
式(XVII)及び式(XIX)の化合物は新規であり、それらは、既知調製方法により調製することができる（例えば、以下のものを参照されたい：Compagnon, Ann. Chim. (Paris) [14] 5, pp. 11-22, 23-27 (1970), L. Munday, J. Chem. Soc. 4372 (1961); J.T. Eward, C. Jitrangeri, Can. J. Chem. 53, 3339 (1975)）。

【0202】

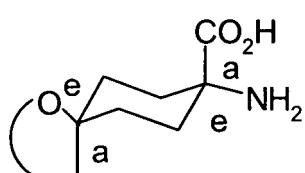
新規1-アミノ-シクロヘキサンカルボン酸(XIX)は、一般に、ブヘラ・ベルクス合成(Bucherer Bergs synthesis)又はストレッカー合成(Strecker synthesis)によって得ることが可能であり、その際、それらは、種々の異性体形態で得られる。簡単にする目的として、以下では、4位の酸素原子とアミノ基が「エクアトリアル/アキシャル」又は「アキシャル/エクアトリアル」の配置にある異性体を「」と称する。簡単にすることを目的として、以下では、アミノ基と4位の酸素原子が「エクアトリアル/エクアトリアル」又は「アキシャル/アキシャル」である異性体を「」と称する。

【0203】

【化 7 1】



例: β-異性体



例: α-異性体

10

20

30

40

50

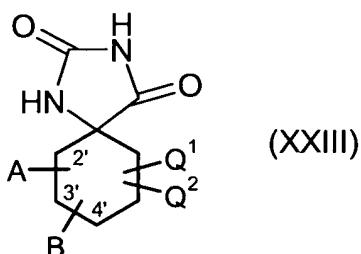
(L. Munday, J. Chem. Soc. 4372 (1961))。

【0204】

式(XIX)の化合物は、式(XXXIII)

【0205】

【化72】



10

[式中、A、B、Q¹及びQ²は、上記で与えられている意味を有する。]の化合物から得ることができる。

【0206】

式(XXXIII)の化合物は、新規であり、文献によって知られている方法で調製することができる（例えば、「ブヘラ-ベルクス反応（Bucherer-Bergs reaction）」；実施例も参照されたい。）。

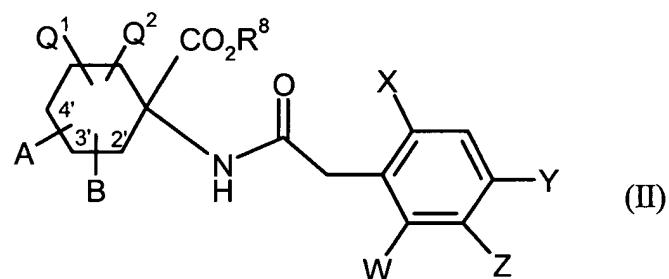
【0207】

20

さらに、上記調製方法(A)で使用される、式(II)

【0208】

【化73】



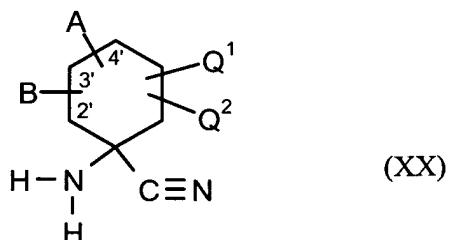
30

[式中、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z及びR⁸は、上記で与えられている意味を有する。]

の出発物質は、式(XX)

【0209】

【化74】

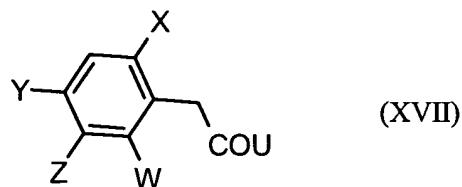


40

[式中、A、B、Q¹及びQ²は、上記で与えられている意味を有する。]の1-アミノシクロヘキサンカルボニトリルを、式(XVII)

【0210】

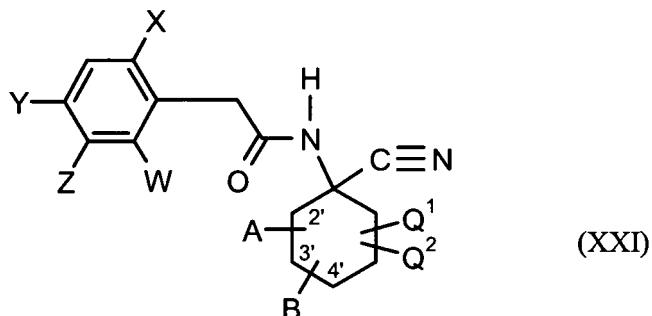
【化75】



[式中、U、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。]
の置換フェニル酢酸誘導体と反応させて、式(XXI) 10

【0211】

【化76】



[式中、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。]
の化合物を生成させ、次いで、これらの化合物を酸性加アルコール分解に付すことにより調製することができる。 20

【0212】

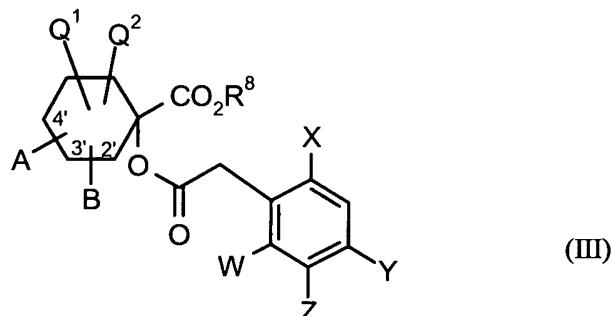
式(XXI)の化合物も、同様に、新規である。式(XX)の化合物の一部は新規であり、それらは、例えば、EP-A-595130に記載されているのと同様にして、調製することができる。 30

【0213】

本発明の調製方法(B)において出発物質として必要とされる式(III)

【0214】

【化77】



[式中、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z及びR⁸は、上記で与えられている意味を有する。]

の化合物は、新規である。 40

【0215】

それらは、原理上は知られている方法によって、容易に調製することが可能である。

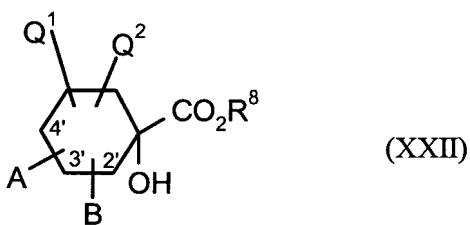
【0216】

50

式(III)の化合物は、例えば、式(XXII)

【0217】

【化78】



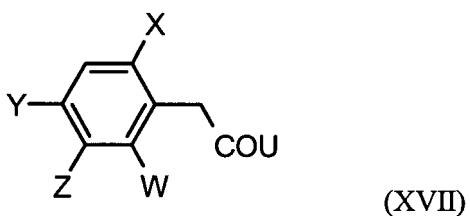
10

[式中、A、B、Q¹、Q²及びR⁸は、上記で与えられている意味を有する。]

の1-ヒドロキシシクロヘキサンカルボン酸エステルを、式(XVII)

【0218】

【化79】



20

[式中、U、W、X、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。]

の置換フェニル酢酸誘導体を用いてアシリ化すれば得られる (Chem. Reviews 52, 237-416 (1953))。

【0219】

式(XXXI)の1-ヒドロキシ-3-アルコキシシクロヘキシルカルボン酸エステルは、新規である。それらは、例えば、置換1-ヒドロキシ-4,4'-アルキリデニルオキシシクロヘキサンカルボニトリルを、例えばピンナー (Pinner) に従い、酸の存在下でアルコールと反応させれば得られる。そのシアノヒドリンは、例えば、置換4,4'-アルキリデニルオキシシクロヘキサン-1-オンをシアノ化水素酸と反応させれば得られる (WO 99/16748 を参照されたい。)。

30

【0220】

本発明の調製方法(C)、(D)、(E)、(F)、(G)、(H)、(I)及び(J)を実施するための出発物質としてさらに必要とされる、式(IV)の酸ハロゲン化物、式(V)のカルボン酸無水物、式(VI)のクロロギ酸エステル又はクロロギ酸チオエステル、式(VII)のクロロモノチオギ酸エステル又はクロロジチオギ酸エステル、式(VIII)の塩化スルホニル、式(IX)のリン化合物、式(X)及び式(XI)の金属水酸化物、金属アルコキシド又はアミン、式(XII)のイソシアネート、式(XIII)の塩化カルバモイル、並びに、式(XV)のボロン酸は、有機化学又は無機化学の一般に知られている化合物である。

40

【0221】

さらに、式(XVII)、式(I-1-a')から式(I-2-g')及び式(I-1-a")から式(I-2-g")の化合物は、最初に引用した特許出願により知られている、及び/又は、それらは、それらの刊行物に記載されている方法で調製することができる。

【0222】

調製方法(A)は、式(II) [式中、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z及びR⁸は、上記で定義されているとおりである。] の化合物を、希釈剤の存在下、及び、塩基の存在下で、分子内縮合に付すことを特徴とする。

【0223】

50

本発明の調製方法(A)において希釈剤として使用するのに適しているものは、当該反応物に対して不活性な全ての有機溶媒である。好ましくは、炭化水素類、例えば、トルエン及びキシレン、さらにまた、エーテル類、例えば、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、グリコールジメチルエーテル及びジグリコールジメチルエーテル、さらにまた、極性溶媒、例えば、ジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルホルムアミド及びN-メチルピロリドン、さらにまた、アルコール類、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール、イソブタノール及びtert-ブタノールなどを使用する。

【0224】

本発明の調製方法(A)を実施するのに適する塩基(脱プロトン化剤)は、全ての慣習的なプロトン受容体である。好ましくは、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の酸化物、水酸化物及び炭酸塩、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、酸化マグネシウム、酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム及び炭酸カルシウムなどを使用し、ここで、これらは、相間移動触媒(例えば、トリエチルベンジルアンモニウムクロリド、テトラブチルアンモニウムプロミド、Adogen 464 (=メチルトリアルキル(C₈-C₁₀)アンモニウムクロリド)又はTDA 1 (=トリス(メトキシエトキシエチル)アミン)など)の存在下で使用することもできる。さらにまた、アルカリ金属、例えば、ナトリウム又はカリウムなどを使用することも可能である。さらにまた、アルカリ金属及びアルカリ土類金属のアミド類及び水素化物、例えば、ナトリウムアミド、水素化ナトリウム及び水素化カルシウムなどを使用することも可能であり、さらにまた、アルカリ金属アルコキシド類、例えば、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド及びカリウムtert-ブトキシドなどを使用することも可能である。

【0225】

本発明の調製方法(A)を実施する場合、その反応温度は、比較的広い範囲内で変えることができる。一般に、該調製方法は、-75から200の温度、好ましくは、-50から150の温度で実施する。本発明の調製方法(A)は、一般に、大気圧下で実施する。

【0226】

本発明の調製方法(A)を実施する場合、式(II)の反応成分及び脱プロトン性塩基は、一般に、約2倍モル量で使用する。しかしながら、一方の成分又は他方の成分を比較的大過剰量(3molまでの量)で用いることも可能である。

【0227】

調製方法(B)は、式(III)[式中、A、B、Q¹、Q²、W、X、Y、Z及びR⁸は、上記で定義されているとおりである。]の化合物を、希釈剤の存在下、及び、塩基の存在下で、分子内縮合に付すことを特徴とする。

【0228】

本発明の調製方法(B)において希釈剤として使用するのに適しているものは、当該反応物に対して不活性な全ての有機溶媒である。好ましくは、炭化水素類、例えば、トルエン及びキシレン、さらにまた、エーテル類、例えば、ジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、グリコールジメチルエーテル及びジグリコールジメチルエーテル、さらにまた、極性溶媒、例えば、ジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルホルムアミド及びN-メチルピロリドンなどを使用する。アルコール類、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール、イソブタノール及びtert-ブタノールなどを使用することも可能である。

【0229】

本発明の調製方法(B)を実施するのに適切な塩基(脱プロトン化剤)は、全ての慣習的なプロトン受容体である。好ましくは、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の酸化物、水酸化物及び炭酸塩、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、酸化マグネシウム、酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム及び炭酸カルシウムなどを使用し、ここで、これらは、相間移動触媒(例えば、トリエチルベンジルアンモニウムクロリド、テト

10

20

30

40

50

ラブチルアンモニウムプロミド、Adogen 464 (=メチルトリアルキル(C₈-C₁₀)アンモニウムクロリド)又はTDA 1 (=トリス(メトキシエトキシエチル)アミン)など]の存在下で使用することもできる。さらにまた、アルカリ金属、例えば、ナトリウム又はカリウムなどを使用することも可能である。さらにまた、アルカリ金属及びアルカリ土類金属のアミド類及び水素化物、例えば、ナトリウムアミド、水素化ナトリウム及び水素化カルシウムなどを使用することも可能であり、さらにまた、アルカリ金属アルコキシド類、例えば、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド及びカリウムtert-ブトキシドなどを使用することも可能である。

【0230】

本発明の調製方法(B)を実施する場合、その反応温度は、比較的広い範囲内で変えることができる。一般に、該調製方法は、-75から200の温度、好ましくは、-50から150の温度で実施する。10

【0231】

本発明の調製方法(B)は、一般に、大気圧下で実施する。

【0232】

本発明の調製方法(B)を実施する場合、式(III)の反応成分及び脱プロトン性塩基は、一般に、ほぼ等モル量で使用する。しかしながら、一方の成分又は他方の成分を比較的大過剰量(3molまでの量)で用いることも可能である。

【0233】

調製方法(C)は、式(I-1-a)から式(I-2-a)の化合物を、それぞれ、適切な場合には希釈剤の存在下、及び、適切な場合には酸結合剤の存在下で、式(IV)のハロゲン化カルボニルと反応させることを特徴とする。20

【0234】

本発明の調製方法(C)において使用するのに適する希釈剤は、該酸ハロゲン化物に対して不活性な全ての溶媒である。好ましくは、炭化水素類、例えば、ベンジン、ベンゼン、トルエン、キシレン及びテトラリン、さらにまた、ハロゲン化炭化水素類、例えば、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、クロロベンゼン及びo-ジクロロベンゼン、さらにまた、ケトン類、例えば、アセトン及びメチルイソプロピルケトン、さらにまた、エーテル類、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサン、さらにまた、カルボン酸エステル類、例えば、酢酸エチル、さらにまた、強極性溶媒、例えば、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド及びスルホランなどを使用する。該酸ハロゲン化物は加水分解安定性を有しているので、該反応は水の存在下でも実施可能である。30

【0235】

本発明の調製方法(C)による反応に適した酸結合剤は、全ての慣習的な酸受容体である。好ましくは、第三級アミン類、例えば、トリエチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロオクタン(DABC0)、ジアザビシクロウンデセン(DBU)、ジアザビシクロノネン(DBN)、ヒューニッヒ塩基及びN,N-ジメチルアニリン、さらにまた、アルカリ土類金属酸化物、例えば、酸化マグネシウム及び酸化カルシウム、さらにまた、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム及び炭酸カルシウム、さらにまた、アルカリ金属水酸化物、例えば、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウムなどを使用する。40

【0236】

本発明の調製方法(C)における反応温度は、比較的広い範囲内で変えることができる。一般に、該調製方法は、-20から+150の温度、好ましくは、0から100の温度で実施する。

【0237】

本発明の調製方法(C)を実施する場合、式(I-1-a)から式(I-2-a)の出発物質及び式(IV)のハロゲン化カルボニルは、一般に、それぞれ、ほぼ等量で使用する。しかしながら、ハロゲン化カルボニルを比較的大過剰量(5molまでの量)で用いることも可能である。後処理は、慣習的な方法で行う。50

【0238】

調製方法(C)は、式(I-1-a)から式(I-2-a)の化合物を、それぞれ、適切な場合には希釈剤の存在下、及び、適切な場合には酸結合剤の存在下で、式(V)のカルボン酸無水物と反応させることを特徴とする。

【0239】

本発明の調製方法(C)において希釈剤として使用するのに適しているものは、好ましくは、酸ハロゲン化物を用いたときにも同様に好ましい希釈剤である。なお、過剰量のカルボン酸無水物を、同時に、希釈剤として作用させることも可能である。

【0240】

調製方法(C)において、適切な場合には適する酸結合剤を添加するが、そのような酸結合剤は、好ましくは、酸ハロゲン化物を用いたときにも同様に好ましい酸結合剤である。10

【0241】

本発明の調製方法(C)における反応温度は、比較的広い範囲内で変えることができる。一般に、該調製方法は、-20から+150の温度、好ましくは、0から100の温度で実施する。

【0242】

本発明の調製方法(C)を実施する場合、式(I-1-a)から式(I-2-a)の出発物質及び式(V)のカルボン酸無水物は、一般に、それぞれ、ほぼ等量で使用する。しかしながら、カルボン酸無水物を比較的大過剰量(5molまでの量)で用いることも可能である。後処理は、慣習的な方法で行う。20

【0243】

一般に、希釈剤及び過剰なカルボン酸無水物及び形成されたカルボン酸は、蒸留により除去するか、又は、有機溶媒若しくは水で洗浄することにより除去する。

【0244】

該調製方法(D)は、式(I-1-a)から式(I-2-a)の化合物を、それぞれ、適切な場合には希釈剤の存在下、及び、適切な場合には酸結合剤の存在下で、式(VI)のクロロギ酸エステル又はクロロギ酸チオエステルと反応させることを特徴とする。

【0245】

本発明の調製方法(D)による反応に適した酸結合剤は、全ての慣習的な酸受容体である。好ましくは、第三級アミン類、例えば、トリエチルアミン、ピリジン、DABCO、DBU、DBA、ヒューニッヒ塩基及びN,N-ジメチルアニリン、さらにまた、アルカリ土類金属酸化物、例えば、酸化マグネシウム及び酸化カルシウム、さらにまた、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム及び炭酸カルシウム、さらにまた、アルカリ金属水酸化物、例えば、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウムなどを使用する。30

【0246】

本発明の調製方法(D)において使用するに適する希釈剤は、該クロロギ酸エステル又はクロロギ酸チオエステルに対して不活性な全ての溶媒である。好ましくは、炭化水素類、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン及びテトラリン、さらにまた、ハロゲン化炭化水素類、例えば、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、クロロベンゼン及びo-ジクロロベンゼン、さらにまた、ケトン類、例えば、アセトン及びメチルイソプロピルケトン、さらにまた、エーテル類、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサン、さらにまた、カルボン酸エステル類、例えば、酢酸エチル、さらにまた、ニトリル類、例えば、アセトニトリル、さらにまた、強極性溶媒、例えば、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド及びスルホランなどを使用する。40

【0247】

本発明の調製方法(D)を実施する場合、その反応温度は、比較的広い範囲内で変えることができる。反応温度は、一般に、-20から+100、好ましくは、0から50である。50

【0248】

本発明の調製方法(D)は、一般に、大気圧下で実施する。

【0249】

本発明の調製方法(D)を実施する場合、式(I - 1 - a)から式(I - 2 - a)の出発物質及び式(V I)の適切なクロロギ酸エステル又はクロロギ酸チオエステルは、一般に、それぞれ、ほぼ等量で使用する。しかしながら、一方の成分又は他方の成分を比較的大過剰量(2 m o lまでの量)で用いることも可能である。後処理は、慣習的な方法で行う。一般に、沈殿した塩を除去し、残った反応混合物は、減圧下で希釈剤を除去することにより濃縮する。

【0250】

10

本発明の調製方法(E)は、式(I - 1 - a)から式(I - 2 - a)の化合物を、それぞれ、希釈剤の存在下、及び、適切な場合には酸結合剤の存在下で、式(V I I)の化合物と反応させることを特徴とする。

【0251】

調製方法(E)においては、0から120、好ましくは、20から60で、式(I - 1 - a)から式(I - 2 - a)の出発物質1モル当たり、約1m o lの式(V I I)のクロロモノチオギ酸エステル又はクロロジチオギ酸エステルを反応させる。

【0252】

20

適切な場合には適する希釈剤を添加するが、そのような希釈剤は、全ての不活性な極性有機溶媒、例えば、エーテル類、アミド類、スルホン類、スルホキシド類や、さらにまた、ハロゲン化アルカン類などである。

【0253】

好ましくは、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、酢酸エチル又は塩化メチレンを使用する。

【0254】

好ましい実施形態において、強脱プロトン化剤(例えば、水素化ナトリウム又はカリウム t e r t - ブトキシド)を添加することにより、化合物(I - 1 - a)から化合物(I - 2 - a)のエノラート塩を調製する場合、酸結合剤をさらに添加することは省くことができる。

【0255】

30

調製方法(E)において使用するのに適する塩基は、全ての慣習的なプロトン受容体である。好ましくは、アルカリ金属水素化物、アルカリ金属アルコキシド類、アルカリ金属若しくはアルカリ土類金属の炭酸塩若しくは重炭酸塩、又は、窒素塩基を使用する。例えば、水素化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、水酸化ナトリウム、水酸化カルシウム、炭酸カリウム、重炭酸ナトリウム、トリエチルアミン、ジベンジルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン、キノリン、ジアザビシクロオクタン(D A B C O)、ジアザビシクロノネン(D B N)及びジアザビシクロウンデセン(D B U)などを挙げることができる。

【0256】

40

該反応は、大気圧下又は高圧下で実施することが可能であり、好ましくは、大気圧下で実施する。後処理は、慣習的な方法で行う。

【0257】

本発明の調製方法(F)は、式(I - 1 - a)から式(I - 2 - a)の化合物を、それぞれ、適切な場合には希釈剤の存在下、及び、適切な場合には酸結合剤の存在下で、式(V I I I)の塩化スルホニルと反応させることを特徴とする。

【0258】

調製方法(F)においては、-20から150、好ましくは、0から70で、式(I - 1 - a)から式(I - 2 - a)の出発物質1モル当たり、約1m o lの式(V I I I)の塩化スルホニルを反応させる。

【0259】

50

調製方法(F)は、好ましくは、希釈剤の存在下で実施する。

【 0 2 6 0 】

適する希釈剤は、全ての不活性な極性有機溶媒、例えば、エーテル類、アミド類、ケトン類、カルボン酸エステル類、ニトリル類、スルホン類、スルホキシド類、又は、ハロゲン化炭化水素類（例えば、塩化メチレン）などである。

【 0 2 6 1 】

好ましくは、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、酢酸エチル又は塩化メチレンを使用する。

【 0 2 6 2 】

好ましい実施形態において、強脱プロトン化剤（例えば、水素化ナトリウム又はカリウム *t e r t - ブトキシド*）を添加することにより、化合物(I - 1 - a)から化合物(I - 2 - a)のエノラート塩を調製する場合、酸結合剤をさらに添加することは省くことができる。10

【 0 2 6 3 】

酸結合剤を使用する場合、慣習的な無機塩基又は有機塩基、例えば、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、ピリジン又はトリエチルアミンなどが適している。

【 0 2 6 4 】

該反応は、大気圧下又は高圧下で実施することが可能であり、好ましくは、大気圧下で実施する。後処理は、慣習的な方法で行う。

【 0 2 6 5 】

本発明の調製方法(G)は、式(I - 1 - a)から式(I - 2 - a)の化合物を、それぞれ、適切な場合には希釈剤の存在下、及び、適切な場合には酸結合剤の存在下で、式(IX)のリン化合物と反応させることを特徴とする。20

【 0 2 6 6 】

調製方法(G)においては、式(I - 1 - e)から式(I - 2 - e)の化合物を得るために、-40から150の温度、好ましくは、-10から110の温度で、化合物(I - 1 - a)から化合物(I - 2 - a)の1モル当たり、1から2mol、好ましくは、1から1.3molの式(IX)のリン化合物を用いる。

【 0 2 6 7 】

調製方法(G)は、好ましくは、希釈剤の存在下で実施する。30

【 0 2 6 8 】

適する希釈剤は、全ての不活性な極性有機溶媒、例えば、エーテル類、カルボン酸エステル類、ハロゲン化炭化水素類、ケトン類、アミド類、ニトリル類、スルホン類、スルホキシド類などである。

【 0 2 6 9 】

好ましくは、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド又は塩化メチレンを使用する。

【 0 2 7 0 】

適切な場合には適する酸結合剤を添加するが、そのような酸結合剤は、慣習的な無機塩基又は有機塩基、例えば、水酸化物、炭酸塩又はアミン類などである。例として、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、ピリジン、トリエチルアミンなどを挙げることができる。40

【 0 2 7 1 】

該反応は、大気圧下又は高圧下で実施することが可能であり、好ましくは、大気圧下で実施する。後処理は、有機化学の慣習的な方法で行う。得られた最終生成物を、好ましくは、結晶化若しくはクロマトグラフィー精製により精製するか、又は、いわゆる「初期蒸留(*incipient distillation*)」（即ち、減圧下における揮発性成分の除去）により精製する。

【 0 2 7 2 】

調製方法(H)は、式(I - 1 - a)から式(I - 2 - a)の化合物を、それぞれ、適50

切な場合には希釈剤の存在下で、式(X)の金属水酸化物若しくは金属アルコキシド又は式(XI)のアミンと反応させることを特徴とする。

【 0 2 7 3 】

本発明の調製方法(H)において希釈剤として使用するのに適しているものは、好ましくは、エーテル類、例えば、テトラヒドロフラン、ジオキサン若しくはジエチルエーテル、又は、アルコール類、例えば、メタノール、エタノール若しくはイソプロパノールなどであり、さらにまた、水も適している。本発明の調製方法(H)は、一般に、大気圧下で実施する。その反応温度は、一般に、-20 から 100 、好ましくは、0 から 50 である。

【 0 2 7 4 】

本発明の調製方法(I)は、式(I - 1 - a)から式(I - 2 - a)の化合物を、それぞれ、(I)適切な場合には希釈剤の存在下、及び、適切な場合には触媒の存在下で、式(XII)の化合物と反応させることを特徴とするか、又は、(I)適切な場合には希釈剤の存在下、及び、適切な場合には酸結合剤の存在下で、式(XII)の化合物と反応させることを特徴とする。

【 0 2 7 5 】

調製方法(I)においては、0 から 100 、好ましくは、20 から 50 で、式(I - 1 - a)から式(I - 2 - a)の出発物質 1 モル当たり、約 1 mol の式(XI)のイソシアネートを用いる。

【 0 2 7 6 】

調製方法(I)は、好ましくは、希釈剤の存在下で実施する。

【 0 2 7 7 】

適する希釈剤は、全ての不活性有機溶媒、例えば、芳香族炭化水素類、ハロゲン化炭化水素類、エーテル類、アミド類、ニトリル類、スルホン類及びスルホキシド類などである。

【 0 2 7 8 】

適切な場合には、触媒を添加して反応を促進することができる。触媒として使用するのに適しているものは、極めて有利には、有機スズ化合物、例えば、ジラウリン酸ジブチルスズなどである。

【 0 2 7 9 】

該反応は、好ましくは、大気圧下で実施する。

【 0 2 8 0 】

調製方法(I)においては、0 から 150 、好ましくは、20 から 70 で、式(I - 1 - a)から式(I - 2 - a)の出発物質 1 モル当たり、約 1 mol の式(XI)の塩化カルバモイルを用いる。

【 0 2 8 1 】

適切な場合には適する希釈剤を添加するが、そのような希釈剤は、全ての不活性な極性有機溶媒、例えば、エーテル類、カルボン酸エステル類、ニトリル類、ケトン類、アミド類、スルホン類、スルホキシド類又はハロゲン化炭化水素類などである。

【 0 2 8 2 】

好ましくは、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド又は塩化メチレンを使用する。

【 0 2 8 3 】

好ましい実施形態において、強脱プロトン化剤(例えば、水素化ナトリウム又はカリウム *t e r t* - ブトキシド)を添加することにより、化合物(I - 1 - a)から化合物(I - 2 - a)のエノラート塩を調製する場合、酸結合剤をさらに添加することは省くことができる。

【 0 2 8 4 】

酸結合剤を使用する場合、慣習的な無機塩基又は有機塩基、例えば、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、トリエチルアミン又はピリジンなどが適している。

10

20

30

40

50

【0285】

該反応は、大気圧下又は高圧下で実施することが可能であり、好ましくは、大気圧下で実施する。後処理は、慣習的な方法で行う。

【0286】

本発明の調製方法(J)及び(J)を実施するのに適する触媒は、パラジウム(0)錯体である。例えば、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムが好ましい。適切な場合には、パラジウム(II)化合物、例えば、PdCl₂、Pd(OAc)₂などを使用することも可能である。パラジウム(II)化合物を使用する場合、錯体形成剤(complex former)として、ホスフィン類(例えば、トリシクロヘキシリホスフィン)を一般に使用する。

10

【0287】

本発明の調製方法(J)及び(J)を実施するのに適する酸受容体は、無機塩基又は有機塩基である。そのような無機塩基又は有機塩基としては、好ましくは、アルカリ土類金属又はアルカリ金属の水酸化物、酢酸塩、炭酸塩又は重炭酸塩、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化バリウム又は水酸化アンモニウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウム又は酢酸アンモニウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム又は炭酸アンモニウム、重炭酸ナトリウム又は重炭酸カリウム、アルカリ金属フッ化物、例えば、フッ化セシウム、アルカリ金属リン酸塩、例えば、リン酸二水素カリウム、リン酸カリウム、さらにまた、第三級アミン類、例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジメチルベンジルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、N-メチルモルホリン、N,N-ジメチルアミノピリジン、ジアザビシクロオクタン(DABCO)、ジアザビシクロノネン(DBN)又はジアザビシクロウンデセン(DBU)などを挙げることができる。

20

【0288】

本発明の調製方法(J)及び(J)を実施するのに適する希釈剤は、水、有機溶媒及びそれらの任意の混合物である。以下のものを例として挙げることができる：脂肪族、脂環式又は芳香族の炭化水素類、例えば、石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレン又はデカリン；ハロゲン化炭化水素類、例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、トリクロロエタン又はテトラクロロエチレン；エーテル類、例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルt-ブチルエーテル、メチルt-アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、1,2-ジエトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテル又はアニソール；アルコール類、例えば、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロパノール、n-ブタノール、イソブタノール、sec-ブタノール、tert-ブタノール、エタンジオール、プロパン-1,2-ジオール、エトキシエタノール、メトキシエタノール、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル；水。

30

【0289】

本発明の調製方法(J)及び(J)において、その反応温度は、比較的広い範囲内で変えることができる。一般に、該調製方法は、0から+140の温度、好ましくは、50から+100の温度で実施する。

40

【0290】

本発明の調製方法(J)及び(J)を実施する場合、式(XV)及び式(X V) [式中、Y及びZは、上記で与えられている意味を有する。] のボロン酸と、式(I - 1 - a')から式(I - 2 - g') [式中、A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X、Y及びZ'は、上記で与えられている意味を有する。] の化合物又は式(I - 1 - a'')から式(I - 2 - g'') [式中、A、B、D、G、Q¹、Q²、W、X、Z及びY'は、上記で与えられている意味を有する。] の化合物は、1:1から3:1のモル比、好ましくは、1:1から2:1のモル比で使用する。一般に、式(I - 1 - a')から式(I - 2 -

50

g') 又は式 (I - 1 - a") から式 (I - 2 - g") の化合物 1 モル当たり、0.005 から 0.5 mol、好ましくは、0.01 mol から 0.1 mol の触媒を使用する。上記塩基は、一般に、過剰に使用する。後処理は、慣習的な方法で行う。

【 0 2 9 1 】

本発明の活性化合物は、植物が良好な耐性を示すこと及び温血動物に対する毒性が望ましい程度であること及び環境が良好な耐性を示すことと相まって、植物及び植物の器官を保護するのに適しており、収穫高を増大させるのに適しており、収穫物の質を向上させるのに適しており、また、農業において、園芸において、畜産業において、森林で、庭園やレジャー施設で、貯蔵生産物や材料物質の保護において、及び、衛生学の分野において遭遇する動物有害生物 (animal pest) 、特に、昆虫類、クモ形類動物、蠕虫類、線虫類及び軟体動物を防除するのに適している。それらは、好ましくは、植物保護剤として使用することができる。それらは、通常の感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、さらに、全ての発育段階又は一部の発育段階に対して活性を示す。上記有害生物 (pest) としては、以下のものを挙げることができる :

シラミ目 (Anoplura) (Phthiraptera) の、例えば、ダマリニア属種 (Damalinia spp.) 、ハエマトピヌス属種 (Haematopinus spp.) 、リノグナツス属種 (Linognathus spp.) 、ペジクルス属種 (Pediculus spp.) 、トリコデクテス属種 (Trichodectes spp.) ;

クモ綱 (Arachnida) の、例えば、アカルス・シロ (Acarus siro) 、アセリア・シェルドニ (Aceria sheldoni) 、アクロプス属種 (Aculops spp.) 、アクルス属種 (Aculus spp.) 、アンブリオンマ属種 (Amblyomma spp.) 、アルガス属種 (Argas spp.) 、ボオフィルス属種 (Boophilus spp.) 、ブレビパルpus属種 (Brevipalpus spp.) 、ブリオビア・プラエチオサ (Bryobia praetiosa) 、コリオプテス属種 (Chorioptes spp.) 、デリマニスス・ガリナエ (Dermayssus gallinae) 、エオテトラニクス属種 (Eotetranychus spp.) 、エピトリメルス・ピリ (Epitrimerus pyri) 、エウテトラニクス属種 (Eutetranychus spp.) 、エリオフィエス属種 (Eriophyes spp.) 、ヘミタルソネムス属種 (Hemitarsonemus spp.) 、ヒアロンマ属種 (Hyalomma spp.) 、イクソデス属種 (Ixodes spp.) 、ラトロデクトス・マクタンス (Latrodectus mactans) 、メタテトラニクス属種 (Metatetranychus spp.) 、オリギニクス属種 (Oligonychus spp.) 、オルニトドロス属種 (Ornithodoros spp.) 、パノニクス属種 (Panonychus spp.) 、フィロコプトルタ・オレイボラ (Phyllocoptrus oleivora) 、ポリファゴタルソネムス・ラツス (Polyphagotarsonemus latius) 、プソロプテス属種 (Psoroptes spp.) 、リピセファルス属種 (Rhipicephalus spp.) 、リゾグリフス属種 (Rhizoglyphus spp.) 、サルコプテス属種 (Sarcoptes spp.) 、スコルピオ・マウルス (Scorpio maurus) 、ステノタルソネムス属種 (Stenotarsonemus spp.) 、タルソネムス属種 (Tarsonemus spp.) 、テトラニクス属種 (Tetranychus spp.) 、バサテス・リコペルシシ (Vasates lycopersici) ;

ニマイガイ綱 (Bivalva) の、例えば、ドレイセナ属種 (Dreissena spp.) ;

キロポーダ目 (Chilopoda) の、例えば、ゲオフィルス属種 (Geophilus spp.) 、スクチゲラ属種 (Scutigera spp.) ;

コウチュウ目 (Coleoptera) の、例えば、アカントセリデス・オブテクトス (Acanthoscelides obtectus) 、アドレツス属種 (Adoretus spp.) 、アゲラスチカ・アルニ (Agelastica alni) 、アグリオテス属種 (Agriotes spp.) 、アンフィマロン・ソルスチチアリス (Amphimallon solstitialis) 、アノビウム・ünkタツム (Anobium punctatum) 、アノプロホラ属種 (Anoplophora spp.) 、アントノムス属種 (Anthonomus spp.) 、アントレヌス属種 (Anthrenus spp.) 、アポゴニア属種 (Apogonia spp.) 、アトマリア属種 (Atomaria spp.) 、アタゲヌス属種 (Attagenus spp.) 、ブルキジウス・オブテクトス (Bruchidius obtectus) 、ブルクス属種 (Bruchus spp.) 、セウトリリンクス属種 (Ceuthorhynchus spp.) 、クレオヌス・メンジクス (Cleonus mendicus) 、コノデルス属種 (Conoderus spp.) 、コスマポリテス属種 (Cosmopolites spp.) 、コステリトラ・ゼアランジカ (Costelytra zealandica) 、クルクリオ属種 (Curculio spp.) 、クリプトリンクス・ラパチ (Cryptorhynchus lapathi) 、デルメステス属種 (Dermestes spp.) 、ジアブロ

10

20

30

40

50

チカ属種 (*Diabrotica* spp.)、エピラクナ属種 (*Epilachna* spp.)、ファウスチヌス・クバエ (*Faustinus cubae*)、ジビウム・ブシロイデス (*Gibbium psylloides*)、ヘテロニクス・アラトル (*Heteronychus arator*)、ヒラモルファ・エレガヌス (*Hylamorpha elegans*)、ヒロトルペス・バジュルス (*Hylotrupes bajulus*)、ヒペラ・ポスチカ (*Hypera postica*)、ヒポテネムス属種 (*Hypothenemus* spp.)、ラクノステルナ・コンサングイニア (*Lachnostenra consanguinea*)、レプチノタルサ・デセムリネアタ (*Leptinotarsa decemlineata*)、リソロプトルス・オリゾフィルス (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、リキス属種 (*Lixus* spp.)、リクトス属種 (*Lyctus* spp.)、メリゲテス・アエネウス (*Meligethes aeneus*)、メロロンタ・メロロンタ (*Melolontha melolontha*)、ミゴドルス属種 (*Migdolus* spp.)、モノカムス属種 (*Monochamus* spp.)、ナウパクトス・キサントグラフス (*Naupactus xanthographus*)、ニブツス・ホロレウクス (*Niptus hololeucus*)、オリクテス・リノセロス (*Oryctes rhinoceros*)、オリザエフィルス・スリナメンシス (*Oryzaephilus surinamensis*)、オチオリンクス・スルカツス (*Otiorrhynchus sulcatus*)、オキシセトニア・ジュクンダ (*Oxycetonia jucunda*)、ファエドン・コクレアリアエ (*Phaedon cochleariae*)、フィロファガ属種 (*Phyllophaga* spp.)、ポピリア・ジャポニカ (*Popillia japonica*)、プレムノトリペス属種 (*Premnotypes* spp.)、シリオデス・クリソセファラ (*Psylliodes chrysocephala*)、ブチヌス属種 (*Ptinus* spp.)、リゾビウス・ベントラリス (*Rhizobius ventralis*)、リゾベルタ・ドミニカ (*Rhizophora dominica*)、シトフィルス属種 (*Sitophilus* spp.)、スフェノホルス属種 (*Sphenophorus* spp.)、ステルネクス属種 (*Sternechus* spp.)、シンフィレテス属種 (*Symplyte s* spp.)、テネブリオ・モリトル (*Tenebrio molitor*)、トリボリウム属種 (*Tribolium* spp.)、トロゴデルマ属種 (*Trogoderma* spp.)、チキウス属種 (*Tychius* spp.)、キシロトレクス属種 (*Xylotrechus* spp.)、ザブルス属種 (*Zabrus* spp.)；

トビムシ目 (Collembola) の、例えば、オニキウルス・アルマツス (*Onychiurus armatus*)；

ハサミムシ目 (Dermaptera) の、例えば、ホルフィクラ・アウリクラリア (*Forficula auricularia*)；

ジプローダ目 (Diplopoda) の、例えば、ブラニウルス・グツラツス (*Blaniulus guttulatus*)；

ハエ目 (Diptera) の、例えば、アedes属種 (*Aedes* spp.)、アノフェレス属種 (*Anopheles* spp.)、ビビオ・ホルツラヌス (*Bibio hortulanus*)、カリホラ・エリトロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、セラチチス・カピタタ (*Ceratitis capitata*)、クリソミア属種 (*Chrysomyia* spp.)、コクリオミア属種 (*Cochliomyia* spp.)、コルジオビア・アントロポファガ (*Cordylobia anthropophaga*)、クレクス属種 (*Culex* spp.)、クテレブラ属種 (*Cuterebra* spp.)、ダクス・オレアエ (*Dacus oleae*)、デルマトビア・ホミニス (*Dermatobia hominis*)、ドロソフィラ属種 (*Drosophila* spp.)、ファンニア属種 (*Fannia* spp.)、ガストロフィルス属種 (*Gastrophilus* spp.)、ヒレミイア属種 (*Hylemyia* spp.)、ヒポボスカ属種 (*Hippobosca* spp.)、ヒポデルマ属種 (*Hypoderma* spp.)、リリオミザ属種 (*Liriomyza* spp.)、ルシリア属種 (*Lucilia* spp.)、ムスカ属種 (*Musca* spp.)、ネザラ属種 (*Nezara* spp.)、オエストルス属種 (*Oestrus* spp.)、オシネラ・フリト (*Oscinella frit*)、ペゴミア・ヒオシアミ (*Pegomyia hyoscyami*)、ホルビア属種 (*Phorbia* spp.)、ストモキス属種 (*Stomoxys* spp.)、タバヌス属種 (*Tabanus* spp.)、タンニア属種 (*Tannia* spp.)、チプラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)、ウォールファールチア属種 (*Wohlfahrtia* spp.)；

マキガイ綱 (Gastropoda) の、例えば、アリオン属種 (*Arion* spp.)、ビオムファラリア属種 (*Biomphalaria* spp.)、ブリヌス属種 (*Bulinus* spp.)、デロセラス属種 (*Deroceras* spp.)、ガルバ属種 (*Galba* spp.)、リムナエア属種 (*Lymnaea* spp.)、オンコメラニア属種 (*Oncomelania* spp.)、スクシネア属種 (*Succinea* spp.)；

ゼンチュウ綱 (Helminths) の、例えば、アンシロストマ・ズオデナレ (*Ancylostoma duodenale*)、アンシロストマ・セイラニクム (*Ancylostoma ceylanicum*)、アンシロスト

マ・ブラジリエンシス (*Acylostoma braziliensis*)、アンシロストマ属種 (*Ancylostoma* spp.)、アスカリス・ルブリコイデス (*Ascaris lubricoides*)、アスカリス属種 (*Ascaris* spp.)、ブルギア・マライ (*Brugia malayi*)、ブルギア・チモリ (*Brugia timori*)、ブノストムム属種 (*Bunostomum* spp.)、カベルチア属種 (*Chabertia* spp.)、クロノルキス属種 (*Clonorchis* spp.)、コオペリア属種 (*Cooperia* spp.)、ジクロコエリウム属種 (*Dicrocoelium* spp.)、ジクチオカカルス・フィラリア (*Dictyocaulus filaria*)、ジフィロボトリウム・ラツム (*Diphyllobothrium latum*)、ドラクンクルス・メジネンシス (*Dracunculus medinensis*)、エキノコックス・グラヌロスス (*Echinococcus granulosus*)、エキノコックス・マルチロクラリス (*Echinococcus multilocularis*)、エンテロビウス・ベルミクラリス (*Enterobius vermicularis*)、ファシオラ属種 (*Faciola* spp.)
10))、ハエモンクス属種 (*Haemonchus* spp.)、ヘテラキス属種 (*Heterakis* spp.)、ヒメノレピス・ナナ (*Hymenolepis nana*)、ヒオストロングルス属種 (*Hyostrongulus* spp.)、ロア・ロア (*Loa Loa*)、ネマトジルス属種 (*Nematodirus* spp.)、オエソファゴストムム属種 (*Oesophagostomum* spp.)、オピストルキス属種 (*Opisthorchis* spp.)、オンコセルカ・ボルブルス (*Onchocerca volvulus*)、オステルタギア属種 (*Ostertagia* spp.)
20))、パラゴニムス属種 (*Paragonimus* spp.)、シストソメン属種 (*Schistosomen* spp.)、ストロンギロイデス・ステルコラリス (*Strongyloides stercoralis*)、ストロニロイデス属種 (*Strongyloides* spp.)、タエニア・サギナタ (*Taenia saginata*)、タエニア・ソリウム (*Taenia solium*)、トリキネラ・スピラリス (*Trichinella spiralis*)、トリキネラ・ナチバ (*Trichinella nativa*)、トリキネラ・ブリトビ (*Trichinella britovi*)、トリキネラ・ネルソニ (*Trichinella nelsoni*)、トリキネラ・プセウドブシラリス (*Trichinella pseudospiralis*)、トリコストロングルス属種 (*Trichostrongulus* spp.)、トリクリス・トリクリア (*Trichuris trichuria*)、ウケレリア・バンクロフチ (*Wuchereria bancrofti*)
。

【0292】

さらにまた、エイメリア (*Eimeria*) などの原生動物も防除することができる。

【0293】

ヘロプロテラ目 (Heteroptera) の、例えば、アナサ・トリスチス (*Anasa tristis*)、アンテスキオプシス属種 (*Antestiopsis* spp.)、ブリスス属種 (*Blissus* spp.)、カロコリス属種 (*Calocoris* spp.)、カムピロンマ・リビダ (*Campylomma livida*)、カベレリウス属種 (*Cavelerius* spp.)、シメクス属種 (*Cimex* spp.)、クレオンチアデス・ジルツス (*Creontiades dilutus*)、ダシヌス・ピペリス (*Dasyurus piperis*)、ジケロブス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)、ジコノコリス・ヘウェチ (*Diconocoris hewitti*)、ジスデルクス属種 (*Dysdercus* spp.)、エウシsstス属種 (*Euschistus* spp.)、エウリガステル属種 (*Eurygaster* spp.)、ヘリオペルチス属種 (*Heliopeletis* spp.)、ホルシアス・ノビレルス (*Horcius nobilellus*)、レプトコリサ属種 (*Leptocorisa* spp.)、レプトグロスス・フィロブス (*Leptoglossus phyllopus*)、リグス属種 (*Lygus* spp.)、マクロペス・イクスカバツス (*Macropes excavatus*)、ミリダエ (Miridae)、ネザラ属種 (*Nezara* spp.)、オエバルス属種 (*Oebalus* spp.)、ペントミダエ (Pentomidae)
30) 、ピエスマ・クワドラタ (*Piesma quadrata*)、ピエゾドルス属種 (*Piezodorus* spp.)、プサルス・セリアツス (*Psallus seriatus*)、プセウドアシスタ・ペルセア (*Pseudacysta perseae*)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、サールベルゲラ・シングラリス (*Sahibergella singularis*)、スコチノホラ属種 (*Scotinophora* spp.)、ステファニチス・ナシ (*Stephanitis nashi*)、チブラカ属種 (*Tibraca* spp.)、トリアトマ属種 (*Triatoma* spp.)；

ホモプロテラ目 (Homoptera) の、例えば、アシリトシポン属種 (*Acyrthosipon* spp.)、アエネオラミア属種 (*Aeneolamia* spp.)、アゴノセナ属種 (*Agonoscena* spp.)、アレウロデス属種 (*Aleurodes* spp.)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクスス属種 (*Aleurothrixus* spp.)、アムラカ属種 (*Amraca* spp.)
40) ；

、アヌラフィス・カルズイ (*Anuraphis cardui*)、アオニジエラ属種 (*Aonidiella* spp.)、アファノスチグマ・ピリ (*Aphanostigma piri*)、アphis属種 (*Aphis* spp.)、アルボリジア・アピカリス (*Arboridia apicalis*)、Aspidiella属種 (*Aspidiella* spp.)、Aspidiotus属種 (*Aspidiotus* spp.)、Atanus属種 (*Atanus* spp.)、アウラコルツム・ソラニ (*Aulacorthum solani*)、ベミシア属種 (*Bemisia* spp.)、ブラキカウズス・ヘリクリシイ (*Brachycaudus helichrysii*)、Brachycolus属種 (*Brachycolus* spp.)、Brevicoryne brassicae)、Carneocephala fulgida)、セラトバクナ・ラニゲラ (*Ceratovacuna lanigera*)、Cercopidae)、セロプラステス属種 (*Ceroplastes* spp.)、Chaetosiphon fragaefolii)、Chionaspis tegalensis)、クロリタ・オヌキイ (*Chlorita onukii*)、クロマフィス・ジュグランジコラ (*Chromaphis juglandicola*)、クリソムファルス・フィクス (*Chrysomphalus ficus*)、シカズリナ・ムビラ (*Cicadulina mbila*)、Coccochrysa halleri)、コックス属種 (*Coccus* spp.)、Cryptomyzus ribis)、Dalbulus spp.)、Dialeurodes spp.)、Diaphorina spp.)、Diaspis spp.)、Doralis spp.)、Drosicha spp.)、Dysaphis spp.)、Dysmicoccus spp.)、Empoasca spp.)、Eriosoma spp.)、Erythroneura spp.)、Euscelis bilobatus)、Geococcus coffeae)、Homalodisca coagulata)、Hyalopterus arundinis)、Icerya spp.)、Idiocerus spp.)、Idioscopus spp.)、Laodelphax striatellus)、Lecanium spp.)、Lepidosaphes spp.)、Lipaphis erysimi)、Macrosiphum spp.)、Mahanarva fimbriolata)、Metcalfiella spp.)、Monelliopsis pecanis)、Myzus spp.)、Nasonovia ribisnigri)、Nephrotettix spp.)、Nilaparvata lugens)、Oncometopia spp.)、Orthezia praelonga)、Parabemisia myricae)、Paratriozza spp.)、Parlatoria spp.)、Pemphigus spp.)、Phloeomyzus passerinii)、Phorodon humuli)、Phylloxera spp.)、Pinnaspis a spidistrae)、Planococcus spp.)、Protopulvinaria pyriformis)、Pseudaulacaspis pentagona)、Pseudococcus spp.)、Psylia spp.)、Pteromalus spp.)、Pyrilla spp.)、Quesada gigas)、Rastrococcus spp.)、Rhopalosiphum spp.)、Saissetia spp.)、Scaphoides titanus)、Schizaphis graminum)、Selenaspis articulatus)、Sogata spp.)、Sogatella furcifera)、Sogatodes spp.)、Stictocephala festina)、Tenalaphara malayensis)、Tinocallis caryaefoliae)、Tomaspis spp.)

種 (*Tomaspis* spp.)、トキソプテラ属種 (*Toxoptera* spp.)、トリアレウロデス・バボラリオルム (*Trialeurodes vaporariorum*)、トリオザ属種 (*Trioza* spp.)、チフロシバ属種 (*Typhlocyba* spp.)、ウナスピス属種 (*Unaspis* spp.)、ビテウス・ビチホリイ (*Viteus vitifolii*)；

ハチ目 (Hymenoptera) の、例えば、ジブリオン属種 (*Diprion* spp.)、ホプロカンパ属種 (*Hoplocampa* spp.)、ラシウス属種 (*Lasius* spp.)、モノモリウム・ファラオニス (*Monomorium pharaonis*)、ベスパ属種 (*Vespa* spp.)；

ワラジムシ目 (Isopoda) の、例えば、アルマジリジウム・ブルガレ (*Armadillidium vulgare*)、オニスクス・アセルス (*Oniscus asellus*)、ポルセリオ・スカベル (*Porcellio scaber*)；

シロアリ目 (Isoptera) の、例えば、レチクリテルメス属種 (*Reticulitermes* spp.)、オドントテルメス属種 (*Odontotermes* spp.)；

チョウ目 (Lepidoptera) の、例えば、アクロニクタ・マジョル (*Acronicta major*)、アエジア・レウコメラス (*Aedia leucomelas*)、アグロチス属種 (*Agrotis* spp.)、アラバマ・アルギラセア (*Alabama argillacea*)、アンチカルシア属種 (*Anticarsia* spp.)、バラトラ・ブラシカエ (*Barathra brassicae*)、ブックラトリクス・ツルベリエラ (*Bucculatrix thurberiella*)、ブバルス・ピニアリウス (*Bupalus piniarius*)、カコエシア・ポダナ (*Cacoecia podana*)、カプア・レチクラナ (*Capua reticulana*)、カルポカプサ・ポモネラ (*Carpocapsa pomonella*)、ケイマトビア・ブルマタ (*Cheimatobia brumata*)、キロ属種 (*Chilo* spp.)、コリストネウラ・フミフェラナ (*Choristoneura fumiferana*)、クリシア・アンビグエラ (*Clytia ambiguella*)、クナファロセルス属種 (*Cnaphalocerus* spp.)、エアリアス・インスラナ (*Earias insulana*)、エフェスチア・クエーニエラ (*Ephestia kuehniella*)、エウプロクチス・クリソルホエア (*Euproctis chrysorrhoea*)、エウキソア属種 (*Euxoa* spp.)、フェルチア属種 (*Feltia* spp.)、ガレリア・メロネラ (*Galleria mellonella*)、ヘリコベルパ属種 (*Helicoverpa* spp.)、ヘリオチス属種 (*Heliothis* spp.)、ホフマノフィラ・プセウドスプレテラ (*Hofmannophila pseudospretella*)、ホモナ・マグナニマ (*Homona magnanima*)、ヒポノメウタ・パデラ (*Hyponometa padella*)、ラフィグマ属種 (*Laphygma* spp.)、リトコレチス・プランカルデラ (*Lithocolletis blancardella*)、リトファネ・アンテンナタ (*Lithophane antennata*)、ロキサグロチス・アルビコスタ (*Loxagrotis albicosta*)、リマントリア属種 (*Lymantria* spp.)、マラコソマ・ネウストリア (*Malacosoma neustria*)、マメストラ・ブラシカエ (*Mamestrra brassicae*)、モシス・レパンダ (*Mocis repanda*)、ミチムナ・セパラタ (*Mythimna separata*)、オリア属種 (*Oria* spp.)、オウレマ・オリザエ (*Oulema oryzae*)、パノリス・フランメア (*Panolis flammea*)、ペクチノホラ・ゴシピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、フィロクニスチス・シトレラ (*Phylloconistis citrella*)、ピエリス属種 (*Pieris* spp.)、プルテラ・キシリステラ (*Plutella xylostella*)、プロデニア属種 (*Prodenia* spp.)、プセウダレチア属種 (*Pseudalecia* spp.)、プセウドブルシア・インクルデンス (*Pseudoplusia includens*)、ピラウスタ・ヌビラリス (*Pyrausta nubilalis*)、スポドブテラ属種 (*Spodoptera* spp.)、テルメシア・ゲンマタリス (*Thermesia gemmatalis*)、チネア・ペリオネラ (*Tinea pellionella*)、チネオラ・ビセリエラ (*Tineola bisselliella*)、トルトリクス・ビリダナ (*Tortrix viridana*)、トリコブルシア属種 (*Trichoplusia* spp.)；

バッタ目 (Orthoptera) の、例えば、アケタ・ドメスチクス (*Acheta domesticus*)、プラッタ・オリエンタリス (*Blatta orientalis*)、プラッテラ・ゲルマニカ (*Blattella germanica*)、グリロタルパ属種 (*Gryllotalpa* spp.)、レウコファエア・マデラエ (*Leucophaea maderae*)、ロクスタ属種 (*Locusta* spp.)、メラノプラス属種 (*Melanoplus* spp.)、ペリプラネタ・アメリカナ (*Periplaneta americana*)、シストセルカ・グレガリア (*Schistocerca gregaria*)；

ノミ目 (Siphonaptera) の、例えば、セラトフィルス属種 (*Ceratophyllus* spp.)、キセノプシラ・ケオピス (*Xenopsylla cheopis*)；

10

20

30

40

50

コムカデ目 (Symphyla) の、例えば、スクチゲレラ・インマクラタ (*Scutigerella immaculata*) ;

アザミウマ目 (Thysanoptera) の、例えば、バリオトリップス・ビホルミス (*Baliothrips biformis*)、エンネオトリップス・フラベンス (*Enneothrips flavens*)、フランクリニエラ属種 (*Frankliniella spp.*)、ヘリオトリップス属種 (*Heliothrips spp.*)、ヘルシノトリップス・フェモラリス (*Hercinothrips femoralis*)、カコトリップス属種 (*Kakothrips spp.*)、リピホロトリップス・クルエンタツス (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、シルトトリップス属種 (*Scirtothrips spp.*)、タエニオトリップス・カルダモニ (*Taeniothrips cardamoni*)、トリップス属種 (*Thrips spp.*) ;

シミ目 (Thysanura) の、例えば、レピスマ・サカリナ (*Lepisma saccharina*)。 10

【0294】

植物寄生性線虫としては、例えば、以下のものを挙げることができる：アングイナ属種 (*Anguina spp.*)、アフェレンコイデス属種 (*Aphelenchoides spp.*)、ベロノアイムス属種 (*Belonoaimus spp.*)、ブルサフェレンクス属種 (*Bursaphelenchus spp.*)、ジチレンクス・ジブサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、グロボデラ属種 (*Globodera spp.*)、ヘリオコチレンクス属種 (*Helicotylenchus spp.*)、ヘテロデラ属種 (*Heterodera spp.*)、ロンギドルス属種 (*Longidorus spp.*)、メロイドギネ属種 (*Meloidogyne spp.*)、プラチレンクス属種 (*Pratylenchus spp.*)、ラドホルス・シミリス (*Radopholus similis*)、ロチレンクス属種 (*Rotylenchus spp.*)、トリコドルス属種 (*Trichodorus spp.*)、チレンコリンクス属種 (*Tylenchorhynchus spp.*)、チレンクルス属種 (*Tylenchulus spp.*)、チレンクルス・セミペネトランス (*Tylenchulus semipenetrans*)、キシフィネマ属種 (*Xiphinema spp.*)。

【0295】

適切な場合には、本発明の化合物は、特定の濃度又は特定の施用量において、除草剤、薬害軽減剤、成長調節剤若しくは植物の特性を改善する作用薬としても使用し得るか、又は、殺微生物剤 (microbiocide) として、例えば、殺菌剤 (fungicide)、抗真菌剤 (antimycotic)、殺細菌剤若しくは殺ウイルス剤 (これは、ウイロイドに対する作用薬も包含する。) としても使用し得るか、又は、MLO (マイコプラズマ様生物) 及びRLO (リケッチャ様生物) に対する作用薬としても使用し得る。適切な場合には、本発明の化合物は、別の活性化合物を合成するための中間体又は前駆物質としても使用することができる。

【0296】

本発明に従って、全ての植物及び植物の全ての部分を処理することができる。本発明に関連して、植物は、望ましい野生植物及び望ましくない野生植物又は作物植物（天然に発生している作物植物を包含する。）のような全ての植物及び植物個体群を意味するものと理解される。作物植物は、慣習的な植物育種法と最適化法によって得ることができる植物であり得るか、又は、生物工学的方法と遺伝子工学的方法によって得ることができる植物であり得るか、又は、前記方法の組合せによって得ることができる植物であることができる。そのような作物植物には、トランスジェニック植物も含まれ、また、植物育種家の権利によって保護され得る植物品種又は保護され得ない植物品種も含まれる。植物の部分は、苗条、葉、花及び根などの、植物の地上部及び地下部の全ての部分及び器官を意味するものと理解され、その例として挙げることができるのは、葉、針状葉、葉柄、茎、花、子実体、果実、種子、根、塊茎及び根茎である。収穫物、並びに、栄養繁殖器官 (vegetative propagation material) 及び生殖繁殖器官 (generative propagation material) 、例えば、挿穗、塊茎、根茎、側枝及び種子なども、植物の部分に含まれる。

【0297】

該活性化合物を用いた植物及び植物の部分の本発明による処理は、慣習的な処理方法によって、例えば、浸漬、散布、気化、噴霧、ばらまき、塗布又は注入などによって、直接的に行うか、又は、化合物を植物及び植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることにより行い、また、繁殖器官 (propagation material) の場合、特に種子の

10

20

30

40

50

場合は、さらに、1以上のコーティングを施すことによっても行う。

【0298】

上記活性化合物は、溶液剤、エマルジョン剤、水和剤、水性懸濁液剤、油性懸濁液剤、粉末剤 (powders) 、粉剤 (dusts) 、ペースト剤、可溶性粉末剤、可溶性顆粒剤、さらまき用顆粒剤、サスペンション製剤、活性化合物を含浸させた天然物質、活性化合物を含浸させた合成物質、肥料及びポリマー物質中にマイクロカプセル化したもののような慣習的な製剤に変換することができる。

【0299】

これらの製剤は、既知方法で、例えば、必要に応じて界面活性剤（即ち、乳化剤及び／又は分散剤及び／又は泡形成剤）を使用して、上記活性化合物を增量剤（即ち、液体溶媒及び／又は固体担体）と混合させることにより製造する。そのような製剤は、適切なプラントで調製するか、又は、施用前若しくは施用中に調製する。10

【0300】

補助剤として使用するのに適しているものは、当該組成物自体及び／又はそれから誘導された調製物（例えば、散布液、種子粉衣）に、特定の特性、例えば、特定の技術的特性及び／又特定の生物学的特性などを付与するのに適している物質である。典型的な適する補助剤は、增量剤、溶媒及び担体である。

【0301】

適切な增量剤は、例えば、水、並びに、極性及び非極性の有機化学的液体、例えば、以下の種類から選択されるものである：芳香族及び非芳香族の炭化水素類（例えば、パラフィン類、アルキルベンゼン類、アルキルナフタレン類、クロロベンゼン類）、アルコール類及びポリオール類（これらは、適切な場合には、置換されていてもよく、エーテル化されていてもよく、及び／又は、エステル化されていてもよい。）、ケトン類（例えば、アセトン、シクロヘキサン）、エステル類（これは、脂肪類及び油類を包含する。）及び（ポリ）エーテル類、置換されていない及び置換されているアミン類、アミド類、ラクタム類（例えば、N-アルキルピロリドン類）及びラクトン類、スルホン類及びスルホキシド類（例えば、ジメチルスルホキシド）。

【0302】

使用する增量剤が水である場合、例えば有機溶媒を補助溶媒として使用することもできる。適する液体溶媒は、本質的に、芳香族化合物、例えば、キシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族化合物又は塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン類、クロロエチレン類又は塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサン又はパラフィン類、例えば、石油留分、鉱油及び植物油、アルコール類、例えば、ブタノール又はグリコールとそれらのエーテル及びエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサン、強極性溶媒、例えば、ジメチルスルホキシドなどであり、さらに、水も適している。30

【0303】

適切な固体担体は、例えば、アンモニウム塩、及び、粉碎された天然鉱物、例えば、カオリין、クレー、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリナイト又はケイ藻土、及び、粉碎された合成鉱物、例えば、微粉碎シリカ、アルミナ及びシリケートなどであり；粒剤に適する固体担体は、例えば、粉碎して分別した天然石、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石及び苦灰岩、並びに、さらに、無機及び有機の粗挽き粉からなる合成顆粒や、有機材料、例えば、紙、おがくず、ココナツ殻、トウモロコシ穂軸及びタバコの葉柄などからなる顆粒などであり；適切な乳化剤及び／又は泡形成剤は、例えば、非イオン性及びアニオン性の乳化剤、例えば、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル類、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル類、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリールスルホネート類、及び、さらに、タンパク質加水分解物などであり；適切な分散剤は、非イオン性及び／又はイオン性の物質、例えば、アルコール-POE-及び／又は-POP-エーテル類、酸及び／又はPOP-POEエステル類、アルキルアリール及び／又はPOP-POE4050

エーテル類、脂肪 - 及び / 又は P O P - P O E 付加体、P O E - 及び / 又は P O P - ポリオール誘導体、P O E - 及び / 又は P O P - ソルビタン若しくは糖付加体、アルキル若しくはアリールのスルフェート類、アルキル若しくはアリールのスルホネート類及びアルキル若しくはアリールのホスフェート類又はそれらの対応する P O - エーテル付加体の類から選ばれたものである。さらに、適切なオリゴマー又はポリマー、例えば、ビニルモノマーから誘導されたもの、アクリル酸から誘導されたもの、E O 及び / 又は P O の単独又は例えば(ポリ)アルコール類若しくは(ポリ)アミン類と組み合わせたものから誘導されたもの。さらに、リグニン及びそのスルホン酸誘導体、未変性セルロース及び変性セルロース、芳香族及び / 又は脂肪族スルホン酸並びにそれらのホルムアルデヒドとの付加体なども使用することができる。

10

【0304】

上記製剤において、粘着付与剤、例えば、カルボキシメチルセルロース、粉末又は顆粒又はラテックスの形態にある天然ポリマー及び合成ポリマー、例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニル、並びに、天然のリン脂質、例えば、セファリン及びレシチン、及び、合成リン脂質などを使用することができる。

【0305】

着色剤、例えば、無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタン及びブルーシアンブルー(Prussian Blue)、並びに、有機染料、例えば、アリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、並びに、微量栄養素、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などを使用することができる。

20

【0306】

可能な別の添加剤は、芳香物質、改質されていてもよい鉱油及び植物油、蛹、並びに、栄養素(微量栄養素を包含する。)、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などである。

【0307】

安定剤(例えば、低温安定剤)、防腐剤、酸化防止剤、光安定剤、又は、化学的及び若しくは物理的安定性を向上させる別の作用剤も存在させることができる。

【0308】

上記製剤は、一般に、0.01から9.8重量%の活性化合物、好ましくは、0.5から9.0重量%の活性化合物を含有する。

30

【0309】

本発明の活性化合物は、その市販製剤中において、及び、そのような製剤から調製した使用形態中において、殺虫剤、誘引剤、不妊剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、成長調節物質、除草剤、薬害軽減剤、肥料又は情報化学物質などの他の活性化合物との混合物として使用することが可能である。

【0310】

別の既知活性化合物、例えば、除草剤、肥料、成長調節剤、薬害軽減剤、情報化学物質との混合物も可能であり、又は、植物の特性を改善する作用薬との混合物も可能である。

【0311】

殺虫剤として使用する場合、本発明の活性化合物は、さらにまた、それらの市販されている製剤中においても、及び、それらの製剤から調製された使用形態中においても、協力剤との混合物として存在させることができる。協力剤は、本発明の活性化合物の効果を増大させる化合物であり、その際、加えられる協力剤自体は必ずしも活性を有する必要はない。

40

【0312】

殺虫剤として使用する場合、本発明の活性化合物は、さらにまた、それらの市販されている製剤中においても、及び、それらの製剤から調製された使用形態中においても、抑制剤(inhibitor)との混合物として存在させることも可能であり、ここで、該抑制剤は、使用された後で、植物の周辺又は植物の部分の表面又は植物の組織内において該活性化合物の分解を低減する。

50

【0313】

市販されている製剤から調製した使用形態の上記活性化合物の含有量は、広い範囲内で変えることができる。使用形態における上記活性化合物の濃度は、0.00000001重量%から95重量%の活性化合物、好ましくは、0.00001重量%から1重量%の活性化合物であることができる。

【0314】

当該化合物は、その使用形態に適した慣習的な方法で使用する。

【0315】

上記で既に述べたように、本発明により、全ての植物及びそれらの部分を処理することができる。好ましい実施形態では、野生の植物種及び植物品種、又は、交雑若しくはプロトプラスト融合のような慣習的な生物学的育種法により得られた植物種及び植物品種、並びに、それらの部分を処理する。好ましいさらに別の実施形態では、適切な場合には慣習的な方法と組み合わせた遺伝子工学的方法により得られたトランスジェニック植物及び植物品種（遺伝子組換え生物）及びそれらの部分を処理する。用語「部分（parts）」及び「植物の部分（parts of plants）」及び「植物の部分（plant parts）」については、既に上記で説明した。

10

【0316】

特に好ましくは、本発明により、いずれの場合も市販されているか又は使用されている植物品種の植物を処理する。植物品種は、慣習的な育種又は突然変異誘発又は組換えDNA技術によって得られた、新しい特性（「形質」）を有する植物を意味するものと理解される。これらは、品種、生物型又は遺伝子型であることができる。

20

【0317】

植物種又は植物品種、それらの生育場所及び生育条件（土壤、気候、生育期、養分）に応じて、本発明の処理により、相加効果を超える効果（「相乗効果」）が生じることもあり得る。かくして、例えば、本発明により使用し得る物質及び組成物の施用量の低減及び／又は活性スペクトルの拡大及び／又は活性の増強、植物の生育の向上、高温又は低温に対する耐性の向上、干ばつ又は水中若しくは土壤中に含まれる塩分に対する耐性の向上、開花能力の向上、収穫の容易性の向上、より早い成熟、収穫量の増加、収穫された生産物の品質の向上及び／又は栄養価の増加、収穫された生産物の貯蔵安定性の向上及び／又は加工性の向上などが可能であり、これらは、実際に予期された効果を超えるものである。

30

【0318】

特に有利で有益な形質を植物に付与する遺伝物質を遺伝子修飾により受け取った全ての植物は、本発明により処理するのが好ましいトランスジェニック植物又は植物品種（遺伝子工学により得られたもの）に包含される。そのような形質の例は、植物の向上した生育、高温又は低温に対する耐性、干ばつ又は水中若しくは土壤中に含まれる塩分に対する耐性、向上した開花能力、向上した収穫の容易性、向上した成熟速度、増加した収穫量、収穫された生産物の向上した品質及び／又は向上した栄養価、収穫された生産物の向上した貯蔵安定性及び／又は向上した加工性などである。そのような形質のさらに別の特に重要な例は、害虫及び有害微生物に対する植物の向上した防御、例えば、昆虫類、ダニ類、植物病原性の菌類、細菌類及び／又はウイルス類に対する植物の向上した防御、並びに、特定の除草活性化合物に対する植物の向上した耐性である。挙げることができるトランスジェニック植物の例は、重要な作物植物、例えば、禾穀類（コムギ、イネ）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、トマト、エンドウ及び他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、果実植物（果実のリンゴ、ナシ、柑橘類果実及びグレープを有する果実植物）などであり、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、ワタ、タバコ及びナタネは特に重要である。重要な形質は、特に、植物体内で形成された毒素による、昆虫類、クモ形類動物、線虫類並びにナメクジ類及びカタツムリ類に対する植物の向上した防御であり、特に、バシリス・ツリンギエンシス (*Bacillus thuringiensis*) からの遺伝物質（例えば、遺伝子Cry IA (a)、Cry IA (b)、Cry IA (c)、Cry IIA、Cry IIIA、Cry IIIB2、Cry 9c、Cry 2Ab、Cry 3Bb）

40

50

及び C r y I F 並びにそれらの組合せ)により植物体内で形成された毒素による、昆虫類、クモ形類動物、線虫類並びにナメクジ類及びカタツムリ類に対する植物の向上した防御である(以下、「B t 植物」と称する。)。同様に特に重要な形質は、全身獲得抵抗性(S A R)、システムイン(systemin)、フィトアレキシン、誘導因子並びに抵抗性遺伝子及びそれにより発現されるタンパク質及び毒素による、菌類、細菌類及びウイルスに対する植物の向上した防御である。特に重要であるさらに別の形質は、特定の除草活性化合物、例えば、イミダゾリノン系、スルホニル尿素系、グリホセート又はホスフィノトリシンなどに対する植物の向上した耐性である(例えば、「P A T」遺伝子)。望まれる当該形質を付与する遺伝子は、トランスジェニック植物内で、互いに組み合わせて存在させることも可能である。挙げることができる「B t 植物」の例は、Y I E L D G A R D(登録商標)(例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ)、K n o c k O u t(登録商標)(例えば、トウモロコシ)、S t a r L i n k(登録商標)(例えば、トウモロコシ)、B o l l g a r d(登録商標)(ワタ)、N u c o t n(登録商標)(ワタ)、及び、N e w L e a f(登録商標)(ジャガイモ)の商品名で販売されているトウモロコシ品種、ワタ品種、ダイズ品種及びジャガイモ品種などである。挙げができる除草剤耐性植物の例は、R o u n d u p R e a d y(登録商標)(グリホセートに対する耐性、例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ)、L i b e r t y L i n k(登録商標)(ホスフィノトリシンに対する耐性、例えば、ナタネ)、I M I(登録商標)(イミダゾリノン系に対する耐性)、及び、S T S(登録商標)(スルホニル尿素系に対する耐性、例えば、トウモロコシ)の商品名で販売されているトウモロコシ品種、ワタ品種及びダイズ品種などである。
挙げができる除草剤抵抗性植物(除草剤耐性に関して慣習的な方法で品種改良された植物)としては、C l e a r f i e l d(登録商標)(例えば、トウモロコシ)の商品名で販売されている品種などがある。もちろん、ここで述べたことは、これらの遺伝形質又は今後開発される遺伝形質を有し、将来において開発及び/又は販売されるであろう植物品種にも適用される。

【0319】

上記で挙げた植物は、一般式(I)の化合物及び/又は本発明による活性化合物混合物を用いて、本発明により特に有利に処理することができる。該活性化合物又は混合物について上記で述べた好ましい範囲は、これらの植物の処理にも同様に適用される。特に重要なのは、本明細書内で具体的に言及されている化合物又は混合物による上記植物の処理である。

【0320】

本発明の活性化合物は、植物、衛生及び貯蔵生産物の害虫(pest)に対してのみではなく、マダニ類(hard ticks)、ヒメダニ類(soft ticks)、疥癬ダニ類(mange mites)、ハダニ類(leaf mites)、ハエ類(刺咬性(biting)及び舐性(licking))、寄生性のハエ幼虫、シラミ類、ケジラミ類(hair lice)、ハネジラミ類(feather lice)及びノミ類などの獣医学の分野における動物寄生虫(外部寄生虫及び内部寄生虫)に対しても有効である。これらの寄生虫としては、以下のものを挙げることができる。

【0321】

アノプルリダ目(Anoplurida)の、例えば、ハエマトビヌス属種(Haematopinus spp.)、リノグナツス属種(Linognathus spp.)、ペジクルス属種(Pediculus spp.)、フチルス属種(Phtirus spp.)、ソレノポテス属種(Solenopotes spp.)。

【0322】

マロファギダ目(Mallophagida)並びにアンブリセリナ亜目(Amblycerina)及びイスクノセリナ亜目(Ischnocerina)の、例えば、トリメノポン属種(Trimenopon spp.)、メノポン属種(Menopon spp.)、トリノトン属種(Trinoton spp.)、ボビコラ属種(Bovicola spp.)、ウェルネキエラ属種(Werneekiella spp.)、レピケントロン属種(Lepikentron spp.)、ダマリナ属種(Damalina spp.)、トリコデクテス属種(Trichodectes spp.)、フェリコラ属種(Felicola spp.)。

【0323】

10

20

30

40

50

ハエ目 (Diptera) 並びにネマトセリナ亜目 (Nematocerina) 及びプラキセリナ亜目 (Brachycerina) の、例えば、アedes属種 (Aedes spp.)、アノフェレス属種 (Anopheles spp.)、クレキス属種 (Culex spp.)、シムリウム属種 (Simulium spp.)、エウシムリウム属種 (Eusimulium spp.)、フレボトムス属種 (Phlebotomus spp.)、ルトゾミイヤ属種 (Lutzomyia spp.)、クリコイデス属種 (Culicoides spp.)、クリソプス属種 (Chrysops spp.)、ヒボミトラ属種 (Hybomitra spp.)、アチロツス属種 (Atylotus spp.)、タバヌス属種 (Tabanus spp.)、ハエマトポタ属種 (Haematopota spp.)、フィリポミニア属種 (Philipomyia spp.)、ブラウラ属種 (Braula spp.)、ムスカ属種 (Musca spp.)、ヒドロタエア属種 (Hydrotaea spp.)、ストモキシス属種 (Stomoxys spp.)、ハエマトビア属種 (Haematobia spp.)、モレリア属種 (Morellia spp.)、ファンニア属種 (Fannia spp.)、グロシナ属種 (Glossina spp.)、カリフォラ属種 (Calliphora spp.)、ルシリア属種 (Lucilia spp.)、クリソミニア属種 (Chrysomyia spp.)、ウォールフアールチア属種 (Wohlfahrtia spp.)、サルコファガ属種 (Sarcophaga spp.)、オエストルス属種 (Oestrus spp.)、ヒポデルマ属種 (Hypoderma spp.)、ガステロフィルス属種 (Gasterophilus spp.)、ヒポボスカ属種 (Hippobosca spp.)、リポブテナ属種 (Lipoptena spp.)、メロファグス属種 (Melophagus spp.)。

【0324】

シフォナブテリダ目 (Siphonapterida) の、例えば、プレクス属種 (Pulex spp.)、クテノセファリデス属種 (Ctenocephalides spp.)、キセノプシラ属種 (Xenopsylla spp.)、セラトフィルス属種 (Ceratophyllus spp.)。

【0325】

ヘテロブテリダ目 (Heteroptera) の、例えば、シメクス属種 (Cimex spp.)、トリアトマ属種 (Triatoma spp.)、ロドニウス属種 (Rhodnius spp.)、パンストロンギルス属種 (Panstrongylus spp.)。

【0326】

プラッタリダ目 (Blattarida) の、例えば、プラッタ・オリエンタリス (Blatta orientalis)、ペリプランエタ・アメリカナ (Periplaneta americana)、プラッテラ・ゲルマニカ (Blattella germanica)、スペラ属種 (Supella spp.)。

【0327】

アカリ亜綱 (Acari (Acarina)) 並びにメタスチグマタ目 (Metastigmata) 及びメソスチグマタ目 (Mesostigmata) の、例えば、アルガス属種 (Argas spp.)、オルニトドルス属種 (Ornithodoros spp.)、オトビウス属種 (Oribius spp.)、イクソデス属種 (Ixodes spp.)、アンブリオンマ属種 (Amblyomma spp.)、ボオフィルス属種 (Boophilus spp.)、デルマセントル属種 (Dermacentor spp.)、ハエモフィサリス属種 (Haemophysalis spp.)、ヒアロンマ属種 (Hyalomma spp.)、リピセファルス属種 (Rhipicephalus spp.)、デルマニスス属種 (Dermanyssus spp.)、ライリエチア属種 (Raillietia spp.)、ブネウモニスス属種 (Pneumonyssus spp.)、ステルノストマ属種 (Sternostoma spp.)、バロア属種 (Varroa spp.)。

【0328】

アクチネジダ目 (Actinedida (Prostigmata)) 及びアカリジダ目 (Acaridida (Astigmata)) の、例えば、アカラピス属種 (Acarapis spp.)、ケイレチエラ属種 (Cheyletella spp.)、オルニトケイレチア属種 (Ornithochylella spp.)、ミオビア属種 (Myobia spp.)、ブソレルガテス属種 (Psorergates spp.)、デモデクス属種 (Demodex spp.)、トロムビクラ属種 (Trombicula spp.)、リストロホルス属種 (Listrophorus spp.)、アカルス属種 (Acarus spp.)、チロファグス属種 (Tyrophagus spp.)、カログリフス属種 (Caloglyphus spp.)、ヒポデクテス属種 (Hypodectes spp.)、ブテロリクス属種 (Terolichus spp.)、ブソロブテス属種 (Psoroptes spp.)、コリオブテス属種 (Choriopites spp.)、オトデクテス属種 (Otodectes spp.)、サルコブテス属種 (Sarcopetes spp.)、ノトエドレス属種 (Notoedres spp.)、クネミドコブテス属種 (Knemidocoptes spp.)、シトジテス属種 (Cytodites spp.)、ラミノシオブテス属種 (Laminosioptes spp.)

10

20

30

40

50

。

【0329】

本発明の式(I)の活性化合物は、さらにまた、農業生産性家畜(例えば、ウシ、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ブタ、ロバ、ラクダ、スイギュウ、ウサギ、ニワトリ、シチメンチョウ、アヒル、ガチョウ及びミツバチなど)、他のペット類(例えば、イヌ、ネコ、籠のトリ及び水槽のサカナなど)及びいわゆる実験動物(例えば、ハムスター、モルモット、ラット及びマウスなど)に寄生する節足動物を防除するのにも適している。これらの節足動物を防除することにより、上記動物の死亡事例が低減し、また、生産性(肉、ミルク、羊毛、皮革、卵、蜂蜜などに関する生産性)の低下が軽減される。従って、本発明の活性化合物を使用することにより、より経済的で且つより容易な畜産業が可能である。

10

【0330】

本発明の活性化合物は、獣医学の分野において、また、畜産業において、既知方法で、例えば、錠剤、カプセル剤、頓服水剤(potion)、水薬(drench)、顆粒剤、ペースト剤、大型丸薬、フィードスルー法及び坐剤などの形態で腸内投与することにより、並びに、例えば、注射(筋肉内注射、皮下注射、静脈内注射、腹腔内注射など)及びインプランツなどにより非経口投与することにより、並びに、鼻内投与することにより、並びに、例えば、浸漬(dipping)又は薬浴(bathing)、スプレー、ポアオン及びスポットオン、洗浄及び散粉(powdering)の形態で経皮使用することにより、並びに、当該活性化合物を含有する成形品、例えば、首輪、耳標、尾標、肢バンド(limb bands)、端綱、マーキング装置などを用いて、使用する。

20

【0331】

家畜、家禽及びペットなどに使用する場合、式(I)の活性化合物は、1から80重量%の量の該活性化合物を含有する製剤(例えば、粉末剤、エマルション剤、易流動性組成物など)として、直接的に使用することができるか、又は、100倍から10000倍に稀釀した後で使用することができるか、又は、それらは、薬浴として使用することができる。

【0332】

さらに、本発明の化合物は、工業材料を破壊する昆虫に対しても強い殺虫作用を示すことが見いだされた。

【0333】

30

以下に示す昆虫を、例として、及び、好ましいものとして挙げることができるが、何ら限定するものではない:

甲虫類(beetles)、例えば、ヒロトルペス・バジュルス(*Hylotrupes bajulus*)、クロホルス・ピロシス(*Chlorophorus pilosis*)、アノビウム・ünkタツム(*Anobium punctatum*)、キセストビウム・ルフォビロスム(*Xestobium rufovillosum*)、プチリヌス・ペクチコルニス(*Ptilinus pecticornis*)、デンドロビウム・ペルチネキス(*Dendrobiun pertinex*)、エルノビウス・モリス(*Ernobius mollis*)、プリオビウム・カルピニ(*Priobium carpini*)、リクトス・ブルネウス(*Lyctus brunneus*)、リクトス・アフリカヌス(*Lyctus africanus*)、リクトス・プラニコリス(*Lyctus planicollis*)、リクトス・リネアリス(*Lyctus linearis*)、リクトス・ pubescens(*Lyctus pubescens*)、トロゴキシロン・エクアレ(*Trogoxylon aequale*)、ミンテス・ルギコリス(*Minthes rugicollis*)、キシレボルス属種(*Xyleborus spec.*)、トリプトデンドロン属種(*Tryptodendron spec.*)、アパテ・モナクス(*Apate monachus*)、ボストリクス・カブシニス(*Bostrychus capucins*)、ヘテロボストリクス・ブルネウス(*Heterobostrychus brunneus*)、シノキシロン属種(*Sinoxylon spec.*)、ジノデルス・ミニツス(*Dinoderus minutus*)；

40

膜翅類(hymenopterons)、例えば、シレクス・ジュベンクス(*Sirex juvencus*)、ウロセルス・ギガス(*Urocerus gigas*)、ウロセルス・ギガス・タイグヌス(*Urocerus gigas taignus*)、ウロセルス・アウグル(*Urocerus augur*)；

シロアリ類(termite)、例えば、カラテルメス・フラビコリス(*Kalotermes flavicol*)

50

lis)、クリプトテルメス・ブレビス (*Cryptotermes brevis*)、ヘテロテルメス・インジコラ (*Heterotermes indicola*)、レチクリテルメス・フラビペス (*Reticulitermes flavipes*)、レチクリテルメス・サントネンシス (*Reticulitermes santonensis*)、レチクリテルメス・ルシフグス (*Reticulitermes lucifugus*)、マストテルメス・ダルウィニエンシス (*Mastotermes darwiniensis*)、ズーテルモプシス・ネバデンシス (*Zootermopsis nevadensis*)、コプトテルメス・フォルモサヌス (*Coptotermes formosanus*)；

シミ類 (bristletails)、例えば、レピスマ・サッカリナ (*Lepisma saccharina*)。

【0334】

本発明に関連して、工業材料は、非生物材料、例えば、好ましくは、プラスチック、接着剤、サイズ、紙及び厚紙、皮革、木材及び加工木材製品、並びに、塗料などを意味するものと理解される。

10

【0335】

即時使用可能な (ready-to-use) 組成物には、適切な場合には、別の殺虫剤も含ませることができる、また、適切な場合には、1種類以上の殺菌剤も含ませることができる。

【0336】

可能な付加的な添加剤に関しては、上記で挙げた殺虫剤及び殺菌剤を参照することができる。

【0337】

本発明の化合物は、さらに、海水又は淡海水と接触するもの、例えば、船体、スクリーン、網、建造物、係留設備及び信号システムなどを、付着物から保護するために使用することもできる。

20

【0338】

さらに、本発明の化合物は、単独で、又は、別の活性化合物と組み合わせて、汚れ止め剤として用いることができる。

【0339】

家庭、衛生及び貯蔵生産物の保護において、本発明の活性化合物は、住居、工場の通路、オフィス及び車両の客室などの密閉空間で見られる害虫 (animal pest)、特に、昆虫類、クモ形類動物及びダニ類を防除するのにも適している。それらは、単独で使用することもできるし、又は、上記害虫を防除するための家庭用殺虫剤製品中において、別の活性化合物及び補助剤と組み合わせて使用することもできる。それらは、感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、さらに、全ての成育段階に対して有効である。これらの害虫としては、以下のものを挙げることができる。

30

【0340】

スコルピオニデア目 (Scorpionidea) の、例えば、ブツス・オッシタヌス (*Buthus occitanus*)。

【0341】

ダニ目 (Acarina) の、例えば、アルガス・ペルシクス (*Argas persicus*)、アルガス・レフレクスス (*Argas reflexus*)、ブリオビア属種 (*Bryobia ssp.*)、デルマニスス・ガリナエ (*Dermyssus gallinaceus*)、グリシファグス・ドメスチクス (*Glyciphagus domesticus*)、オルニトドルス・モウバト (*Ornithodoros moubat*)、リピセファルス・サンギイネウス (*Rhipicephalus sanguineus*)、トロムビクラ・アルフレズゲシ (*Trombicula alfreddugesi*)、ネウトロムビクラ・アウツムナリス (*Neutrombicula autumnalis*)、デルマトファゴイデス・ブテロニシムス (*Dermatophagoides pteronissimus*)、デルマトファゴイデス・ホリナエ (*Dermatophagoides farinae*)。

40

【0342】

クモ目 (Araneae) の、例えば、アビクラリイダエ (Aviculariidae)、アラネイダエ (Araneidae)。

【0343】

ザトウムシ目 (Opiliones) の、例えば、プセウドスコルピオネス・ケリフェル (*Pseudoscorpiones chelifer*)、プセウドスコルピオネス・ケイリジウム (*Pseudoscorpiones c*

50

heiridium)、オピリオネス・ファランギウム (*Opiliones phalangium*)。

【0344】

等脚目 (Isopoda) の、例えば、オニスクス・アセルス (*Oniscus asellus*)、ポルセリオ・スカベル (*Porcellio scaber*)。

【0345】

倍脚目 (Diplopoda) の、例えば、プラニウルス・グツラツス (*Blaniulus guttulatus*)、ポリデスマス属種 (*Polydesmus spp.*)。

【0346】

唇脚目 (Chilopoda) の、例えば、ゲオフィルス属種 (*Geophilus spp.*)。

【0347】

シミ目 (Zygentoma) の、例えば、クテノレピスマ属種 (*Ctenolepisma spp.*)、レピスマ・サッカリナ (*Lepisma saccharina*)、レピスマデス・インクイリヌス (*Lepismodes inquilinus*)。

【0348】

ゴキブリ目 (Blattaria) の、例えば、ブラッタ・オリエンタリエス (*Blatta orientalis*)、ブラッテラ・ゲルマニカ (*Blattella germanica*)、ブラッテラ・アサヒナイ (*Blattella asahinai*)、レウコファエア・マデラエ (*Leucophaea maderae*)、パンクロラ属種 (*Panchlora spp.*)、パルコブラッタ属種 (*Parcoblatta spp.*)、ペリプラネタ・アウストララシアエ (*Periplaneta australasiae*)、ペリプラネタ・アメリカナ (*Periplaneta americana*)、ペリプラネタ・ブルネア (*Periplaneta brunnea*)、ペリプラネタ・フリギノサ (*Periplaneta fuliginosa*)、スペラ・ロンギバルバ (*Supella longipalpa*)。

【0349】

サルタトリア目 (Saltatoria) の、例えば、アケタ・ドメスチクス (*Acheta domesticus*)。

【0350】

ハサミムシ目 (Dermaptera) の、例えば、ホルフィクラ・アウリクラリア (*Forficula auricularia*)。

【0351】

シロアリ目 (Isoptera) の、例えば、カロテルメス属種 (*Kalotermes spp.*)、レチクリテルメス属種 (*Reticulitermes spp.*)。

【0352】

チャタテムシ目 (Psocoptera) の、例えば、レピナツス属種 (*Lepinatus spp.*)、リボセリス属種 (*Liposcelis spp.*)。

【0353】

コウチュウ目 (Coleoptera) の、例えば、アントレヌス属種 (*Anthrenus spp.*)、アタゲヌス属種 (*Attagenus spp.*)、デルメステス属種 (*Dermestes spp.*)、ラテチクス・オリザエ (*Latheticus oryzae*)、ネクロビア属種 (*Necrobia spp.*)、プチヌス属種 (*Ptinus spp.*)、リゾペルタ・ドミニカ (*Rhizopertha dominica*)、シトフィルス・グラナリウス (*Sitophilus granarius*)、シトフィルス・オリザエ (*Sitophilus oryzae*)、シトフィルス・ゼアマイス (*Sitophilus zeamais*)、ステゴビウム・パニセウム (*Stegobium paniceum*)。

【0354】

双翅目 (Diptera) の、例えば、アエデス・アエギプチ (*Aedes aegypti*)、アエデス・アルボピクトス (*Aedes albopictus*)、アエデス・タエニオリンクス (*Aedes taeniorhynchus*)、アノフェレス属種 (*Anopheles spp.*)、カリフォラ・エリトロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、クリソゾナ・ブルビアリス (*Chrysotoxum pluvialis*)、クレクス・クインクエファシアツス (*Culex quinquefasciatus*)、クレクス・ピピエンス (*Culex pipiens*)、クレクス・タルサリス (*Culex tarsalis*)、ドロソフィラ属種 (*Drosophila spp.*)、ファンニア・カニクラリス (*Fannia canicularis*)、ムスカ・ドメスチカ (*Musca domestica*)、フレボトムス属種 (*Phlebotomus spp.*)、サルコファガ・カルナリア

10

20

30

40

50

(*Sarcophaga carnaria*)、シムリウム属種 (*Simulium spp.*)、ストモキス・カルシトランス (*Stomoxys calcitrans*)、チプラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)。

【0355】

鱗翅目 (Lepidoptera) の、例えば、アクロイア・グリセラ (*Achroia grisella*)、ガレリア・メロネラ (*Galleria mellonella*)、プロジア・インテルブンクテラ (*Plodia interpunctella*)、チネア・クロアセラ (*Tinea cloacella*)、チネア・ペリオネラ (*Tinea pellionella*)、チネオラ・ビセリエラ (*Tineola bisselliella*)。

【0356】

ノミ目 (Siphonaptera) の、例えば、クテノセファリデス・カニス (*Ctenocephalides canis*)、クテノセファリデス・フェリス (*Ctenocephalides felis*)、プレクス・イリタ 10
ンス (*Pulex irritans*)、ツンガ・ペネトランス (*Tunga penetrans*)、キセノプシラ・ケオピス (*Xenopsylla cheopis*)。

【0357】

膜翅目 (Hymenoptera) の、例えば、カムポノツス・ヘルクレアヌス (*Camponotus herculeanus*)、ラシウス・フリギノスス (*Lasius fuliginosus*)、ラシウス・ニゲル (*Lasius niger*)、ラシウス・ウムブラツス (*Lasius umbratus*)、モノモリウム・ファラオニス (*Monomorium pharaonis*)、パラベスプラ属種 (*Paravespula spp.*)、テトラモリウム・カエスピツム (*Tetramorium caespitum*)。

【0358】

シラミ目 (Anoplura) の、例えば、ペジクルス・フマヌス・カピチス (*Pediculus humanus capitis*)、ペジクルス・フマヌス・コルポリス (*Pediculus humanus corporis*)、ペムフィグス属種 (*Pemphigus spp.*)、フィロエラ・バスタトリクス (*Phylloera vastatrix*)、フチルス・ pubis (*Phthirus pubis*)。 20

【0359】

異翅目 (Heteroptera) の、例えば、シメクス・ヘミプテルス (*Cimex hemipterus*)、シメクス・レクトラリウス (*Cimex lectularius*)、ロジヌス・プロリクスス (*Rhodinus prolixus*)、トリアトマ・インフェスタンス (*Triatoma infestans*)。

【0360】

家庭用殺虫剤の分野においては、それらは、単独で使用するか、又は、別の適切な活性化合物、例えば、リン酸エステル系、カーバメート系、ピレスロイド系、ネオニコチノイド系、成長調節剤又は別の既知の種類の殺虫剤から選択される活性化合物などと組み合わせて使用する。 30

【0361】

それらは、エーロゾル、非加圧スプレー製品、例えば、ポンプスプレー及び噴霧スプレー、自動霧化システム (automatic fogging system)、噴霧器 (fogger)、泡、ゲル、セルロース製又はポリマー製のエバポレーター錠剤を有するエバポレーター製品、液体エバポレーター、ゲル及び膜エバポレーター、プロペラ駆動エバポレーター、エネルギー型蒸発システム又は受動型蒸発システム、防虫紙 (moth papers)、防虫バッグ (moth bags) 及び防虫ゲル (moth gels) において使用されるか、又は、粒剤若しくは粉剤として、ばらまき用の餌 (baits for spreading) に入れて使用されるか、又は、ベイトステーションで使用される。 40

【0362】

本発明の活性化合物は、さらに、枯葉剤、乾燥剤、茎枯剤 (haulm killer) としても使用可能であり、また、特に、除草剤としても使用可能である。雑草は、最も広い意味においては、望まれていない場所で生育している全ての植物を意味するものと理解される。本発明の物質が、非選択性除草剤として作用するか又は選択性除草剤として作用するかは、本質的に、その施用量に依存する。

【0363】

本発明の活性化合物は、例えば、以下の植物において使用することができる。

【0364】

10

20

30

40

50

以下の属の双子葉植物雑草：イチビ属 (*Abutilon*)、ヒユ属 (*Amaranthus*)、ブタクサ属 (*Ambrosia*)、アノダ属 (*Anoda*)、カミツレ属 (*Anthemis*)、アファネス属 (*Aphanes*)、ハマアカザ属 (*Atriplex*)、ヒナギク属 (*Bellis*)、センダングサ属 (*Bidens*)、ナズナ属 (*Capsella*)、ヒレアザミ属 (*Carduus*)、カワラケツメイ属 (*Cassia*)、ヤグルマギク属 (*Centaurea*)、アカザ属 (*Chenopodium*)、アザミ属 (*Cirsium*)、セイヨウヒルガオ属 (*Convolvulus*)、チョウセンアサガオ属 (*Datura*)、ヌスピトハギ属 (*Desmodium*)、エメクス属 (*Emex*)、エゾスズシロ属 (*Erysimum*)、トウダイグサ属 (*Euphorbia*)、チシマオドリコソウ属 (*Galeopsis*)、コゴメギク属 (*Galinsoga*)、ヤエムグラ属 (*Galium*)、フヨウ属 (*Hibiscus*)、サツマイモ属 (*Ipomoea*)、ホウキギ属 (*Kochia*)、オドリコソウ属 (*Lamium*)、マメグンバイナズナ属 (*Lepidium*)、アゼトウガラシ属 (*Lindernia*)、シカギク属 (*Matricaria*)、ハッカ属 (*Mentha*)、ヤマアイ属 (*Mercurialis*)、ザクロソウ属 (*Mullugo*)、ワスレナグサ属 (*Myosotis*)、ケシ属 (*Papaver*)、アサガオ属 (*Pharbitis*)、オオバコ属 (*Plantago*)、タデ属 (*Polygonum*)、スペリヒュ属 (*Portulaca*)、キンポウゲ属 (*Ranunculus*)、ダイコン属 (*Raphanus*)、イヌガラシ属 (*Rorippa*)、キカシグサ属 (*Rotala*)、ギシギシ属 (*Rumex*)、オカヒジキ属 (*Salsola*)、キオン属 (*Senecio*)、セスバニア属 (*Sesbania*)、キンゴジカ属 (*Sida*)、シロガラシ属 (*Sinapis*)、ナス属 (*Solanum*)、ノゲシ属 (*Sonchus*)、ナガボノウルシ属 (*Sphenoclea*)、ハコベ属 (*Stellaria*)、タンポポ属 (*Taraxacum*)、グンバイナズナ属 (*Thlaspi*)、シャジクソウ属 (*Trifolium*)、イラクサ属 (*Urtica*)、クワガタソウ属 (*Veronica*)、スミレ属 (*Viola*)、オナモミ属 (*Xanthium*)。

【0365】

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

【0366】

以下の属の单子葉植物雑草：アエギロップス属 (*Aegilops*)、カモジグサ属 (*Agropyron*)、ヌカボ属 (*Agrostis*)、スズメノテッポウ属 (*Alopecurus*)、セイヨウヌカボ属 (*Ap era*)、カラスマギ属 (*Avena*)、ビロードキビ属 (*Brachiaria*)、スズメノチャヒキ属 (*Bromus*)、クリノイガ属 (*Cenchrus*)、ツユクサ属 (*Commelina*)、ギョウギシバ属 (*Cynodon*)、カヤツリグサ属 (*Cyperus*)、タツノツメガヤ属 (*Dactyloctenium*)、メヒシバ属 (*Digitaria*)、ヒエ属 (*Echinochloa*)、ハリイ属 (*Eleocharis*)、オヒシバ属 (*Eleusine*)、スズメガヤ属 (*Eragrostis*)、ナルコビエ属 (*Eriochloa*)、ウシノケグサ属 (*Festuca*)、テンツキ属 (*Fimbristylis*)、アメリカコナギ属 (*Heteranthera*)、チガヤ属 (*Imperata*)、カモノハシ属 (*Ischaemum*)、アゼガヤ属 (*Leptochloa*)、ドクムギ属 (*Lolium*)、ミズアオイ属 (*Monochoria*)、キビ属 (*Panicum*)、スズメノヒエ属 (*Paspalum*)、クサヨシ属 (*Phalaris*)、アワガエリ属 (*Phleum*)、イチゴツナギ属 (*Poa*)、ツノアイアシ属 (*Rottboellia*)、オモダカ属 (*Sagittaria*)、ホタルイ属 (*Scirpus*)、エノコログサ属 (*Setaria*)、モロコシ属 (*Sorghum*)。

【0367】

以下の属の单子葉植物作物：ネギ属 (*Allium*)、アナナス属 (*Ananas*)、クサスギカズラ属 (*Asparagus*)、カラスマギ属 (*Avena*)、オオムギ属 (*Hordeum*)、イネ属 (*Oryza*)、キビ属 (*Panicum*)、サトウキビ属 (*Saccharum*)、ライムギ属 (*Secale*)、モロコシ属 (*Sorghum*)、ライコムギ属 (*Triticale*)、コムギ属 (*Triticum*)、トウモロコシ属 (*Zea*)。

【0368】

しかしながら、本発明の活性化合物の使用は、決してこれらの属に限定されるものではなく、他の植物にも同じ方法で拡大適用される。

10

20

30

40

50

【0369】

本発明の活性化合物は、その濃度に応じて、例えば、工業地域や線路、及び、樹木があるか又は樹木がない小道や区域における非選択的な雑草防除に適している。同様に、本発明の活性化合物は、多年生作物、例えば、森林、観賞用植林、果樹園、ブドウ園、柑橘類果樹園、ナツツ園、バナナ園、コーヒ園、茶園、ゴム園、油ヤシ園、カカオ園、小果樹園及びホップ畠、芝地、芝生及び牧草地などの雑草を防除するのにも使用できるし、また、1年生作物の中の雑草を選択的に防除するのにも使用できる。

【0370】

本発明の活性化合物は、土壤に使用した場合及び植物の地上部に使用した場合に、強力な除草活性と広い活性スペクトルを示す。それらは、発生前及び発生後のいずれにおいても、単子葉植物作物及び双子葉植物作物において、ある程度、単子葉植物雑草及び双子葉植物雑草を選択的に防除するのにも適している。10

【0371】

本発明の活性化合物は、特定の濃度又は施用量において、害虫 (animal pest) 及び真菌性又は細菌性の植物病害を防除するのにも使用することができる。適切な場合には、それらは、別の活性化合物を合成するための中間体又は前駆物質として使用することもできる。

【0372】

該活性化合物は、溶液剤、エマルジョン剤、水和剤、懸濁液剤、粉末剤 (powder) 、粉剤、ペースト剤、可溶性粉末剤、顆粒剤、サスペンション剤、活性化合物を含浸させた天然物質及び合成物質、並びに、ポリマー物質中の微細カプセルのような慣習的な製剤に変換することができる。20

【0373】

これらの製剤は、既知方法で、例えば、必要に応じて界面活性剤（即ち、乳化剤及び／又は分散剤及び／又は泡形成剤）を使用して、上記活性化合物を增量剤（即ち、液体溶媒及び／又は固体担体）と混合させることにより、製造する。

【0374】

使用する增量剤が水である場合は、例えば、有機溶媒を補助溶媒として使用することもできる。適する液体溶媒は、本質的に、芳香族化合物、例えば、キシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族化合物又は塩素化脂肪族炭化水素類、例えば、クロロベンゼン類、クロロエチレン類又は塩化メチレン、脂肪族炭化水素類、例えば、シクロヘキサン又はパラフィン類、例えば、石油留分、鉱油及び植物油、アルコール類、例えば、ブタノール又はグリコールとそれらのエーテル類及びエステル類、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン及びシクロヘキサン、強極性溶媒、例えば、ジメチルホルムアミド及びジメチルスルホキシドなどであり、さらに、水も適している。30

【0375】

適する固体担体は、例えば、アンモニウム塩、及び、粉碎された天然鉱物、例えば、カオリナイト、クレー、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリナイト又はケイ藻土、及び、粉碎された合成鉱物、例えば、微粉化シリカ、アルミナ及びシリケートなどであり；顆粒剤に適する固体担体は、例えば、粉碎して分別した天然石、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石及び苦灰岩などであり、さらに、無機及び有機の粗挽き粉からなる合成顆粒や、有機材料、例えば、おがくず、ココナツ殻、トウモロコシ穂軸及びタバコの葉柄などからなる顆粒なども適しており；適する乳化剤及び／又は泡形成剤は、例えば、非イオン性及びアニオン性の乳化剤、例えば、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル類、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル類、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリールスルホネート類、及び、タンパク質加水分解物などであり；適する分散剤は、例えば、リグノスルファイト廃液及びメチルセルロースなどである。40

【0376】

上記製剤において、粘着付与剤、例えば、カルボキシメチルセルロース、粉末又は顆粒又はラテックスの形態にある天然及び合成ポリマー、例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニル、並びに、天然のリン脂質、例えば、セファリン及びレシチン、及び、合成リン脂質などを使用することができる。別の使用可能な添加剤は、鉛油又は植物油である。

【0377】

着色剤、例えば、無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタン及びプルシアンブルー(Prussian Blue)、並びに、有機染料、例えば、アリザリン染料、ゾジ染料及び金属フタロシアニン染料、並びに、微量栄養素、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などを使用することができる。

10

【0378】

上記製剤は、一般に、0.1から9.5重量%の活性化合物、好ましくは、0.5から9.0重量%の活性化合物を含有する。

【0379】

本発明の活性化合物は、それ自体で、又は、その製剤中に存在させて、雑草を防除するために、既知の除草剤及び/又は作物植物の耐性を向上させる物質(「薬害軽減剤」)との混合物としても用いることができるが、その際、レディミックス又はタンクミックスが可能である。従って、薬害軽減剤と1種類以上の既知除草剤を含有する除草剤製品との混合物も可能である。

【0380】

20

殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、鳥忌避剤、植物栄養素及び土壤改良剤などの別の既知活性化合物との混合物も可能である。

【0381】

該活性化合物は、それ自体で、又は、その製剤の形態で、又は、その製剤からさらに希釈することにより調製した使用形態で、例えば、即時使用可能な溶液、懸濁液、エマルジョン、粉末、ペースト若しくは顆粒の形態で施用することが可能である。それらは、慣習的な方法で、例えば、流し込み、散布、噴霧又はばらまき(spreading)により施用する。

【0382】

本発明の活性化合物は、植物の発生前及び発生後のいずれにおいても施用することができる。それらは、播種前に、土壤中に混和することもできる。

30

【0383】

本発明の活性化合物の施用量は、実質的な範囲内で変えることができる。その施用量は、本質的に、所望される効果の質に依存する。一般に、該施用量は、土壤表面積1ヘクタール当たり、1gから10kgの活性化合物、好ましくは、1ヘクタール当たり、5gから5kgの活性化合物である。

【0384】

本発明の活性化合物組合せが有する作物植物との適合性の有利な効果は、特定の濃度比において特に顯著である。しかしながら、当該活性化合物組合せ中の活性化合物の重量比は、比較的広い範囲内で変えることができる。一般に、式(I)の活性化合物の1重量部当たり、0.001から1000重量部、好ましくは、0.01から100重量部、特に好ましくは、0.05から20重量部の(b')として上記で挙げられている作物植物の適合性を改善する化合物(解毒剤/薬害軽減剤)のうちの1種類を存在させる。

40

【0385】

本発明の活性化合物は、一般に、完成された製剤の形態で施用する。しかしながら、当該活性化合物組合せに含まれている活性化合物は、個々の製剤として使用に際して混合させることも可能である。即ち、タンクミックスの形態で施用することが可能である。

【0386】

特定の施用に関し、特に、発生後処理方法による特定の施用に関し、製剤中のさらなる添加剤として、植物が耐性を示す鉛油若しくは植物油(例えば、市販品「Rakobi」)

50

n o l 」) 又はアンモニウム塩(例えば、硫酸アンモニウム又はチオシアン酸アンモニウム)を含有させるのがさらに有利であり得る。

【0387】

該新規活性化合物は、それ自体で、又は、その製剤の形態で、又は、その製剤からさらに希釈することにより調製した使用形態で、例えば、即時使用可能な溶液、懸濁液、エマルジョン、粉末、ペースト若しくは顆粒の形態で使用することが可能である。施用は、慣習的な方法で、例えば、流し込み、散布、噴霧、散粉又はばらまき(scattering)により行う。

【0388】

本発明の活性化合物の施用量は、特定の範囲内で変えることができる。その施用量は、
とりわけ、天候及び土壤因子に左右される。一般に、その施用量は、1ha当たり0.0
01から5kg、好ましくは、1ha当たり0.005から2kg、特に好ましくは、1
ha当たり0.01から0.5kgである。

10

【0389】

本発明の活性化合物は、植物の発生前及び発生後に施用することができる。即ち、
発生前処理法及び発生後処理法によって施用することができる。

【0390】

本発明に従って使用される薬害軽減剤は、それらの特性に応じて、作物植物の種子を前
処理(種子粉衣)するために使用し得るか、又は、播種前にまき溝内に導入し得るか、又
は、植物の発生前若しくは発生後に除草剤より先に独立して若しくは除草剤と一緒に使用
し得る。

20

【0391】

挙げができる植物の例は、重要な作物植物、例えば、禾穀類(コムギ、オオムギ
、イネ)、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、ワタ、ナタネ、ビート、サトウキビ、及
び、果実植物(果実のリンゴ、ナシ、柑橘類果実及びブドウの蔓を有する果実植物)など
であり、禾穀類、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、ワタ及びナタネは特に重要である
。

【0392】

用語「活性化合物」には、本明細書で言及されている活性化合物組合せも常に包含され
る。

30

【実施例】

【0393】

本発明の活性化合物の調製及び使用について、下記実施例によって例証する。

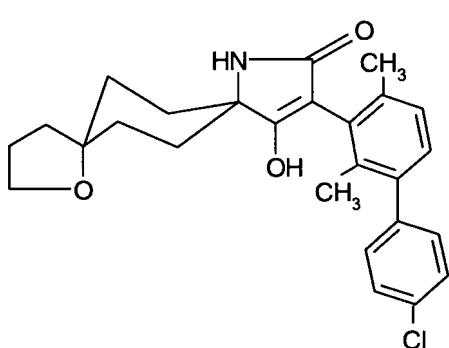
【0394】

調製実施例:

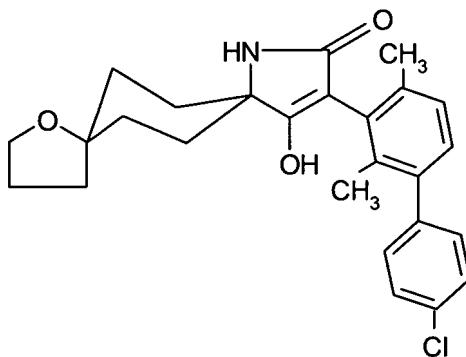
実施例(I-1-a-1)、実施例(I-1-a-2)

【0395】

【化 8 0】



I-1-a-1

 α - 異性体

I-1-a-2

 β - 異性体

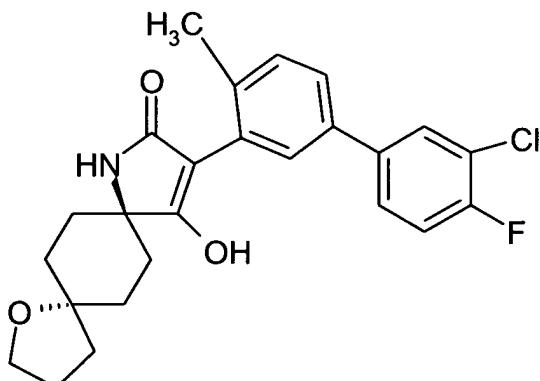
3 mL の N , N - ジメチルアセトアミド (D M A) の中に、最初に 0 . 9 5 g (8 . 5 mmol) のカリウム t e r t - ブトキシドを入れる。60 度、1 . 6 g (3 . 4 mmol) の実施例 (I I - 1) の化合物を滴下して加え、攪拌を 1 . 5 時間続ける。その反応混合物を氷水中に注ぎ入れ、希塩酸を用いて酸性化し、吸引濾過する。その残留物を、シクロヘキサン / 酢酸エチル勾配 (5 0 % - 8 0 %) を用いる中圧シリカゲルクロマトグラフィーによって前精製する。アセトニトリル / 水 / ギ酸 (4 3 : 5 6 : 1) を用いる H P L C (K r o m a s i l 1 0 0 C 1 8) でさらに精製することにより、0 . 1 6 g (理論値の 1 0 . 7 %) の化合物 (I - 1 - a - 1) [m . p . 3 1 1] 及び 0 . 0 8 g (理論値の 5 . 4 %) の化合物 (I - 1 - a - 2) [m . p . 3 0 7] が得られる。

【 0 3 9 6 】

実施例 (I - 1 - a - 4 6)

【 0 3 9 7 】

【化 8 1】



1 5 mL の水の中に、最初に、0 . 5 8 8 g (1 . 5 mmol) の実施例 (I - 1 - a - 2 8) の化合物、0 . 3 1 4 g (1 . 8 mmol) の 3 - クロロ - 4 - フルオロフェニルボロン酸及び 0 . 8 g (7 . 5 mmol) の炭酸ナトリウムを入れ、3 7 mg (0 . 1 5 mmol) の硝酸パラジウム (I I) 二水和物を添加し、得られた混合物を予め加熱してある油浴内で 1 3 0 度一晩攪拌する。冷却後、その混合物を希塩酸を用いて酸性化し、吸引濾過する。その水相を塩化メチレンで抽出し、有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、濃縮する。両方の画分を、シクロヘキサン + 0 - 4 0 % アセトン (勾配) を用いる逆相カートリッジ上で M P L C で一緒に精製する。

10

20

30

40

50

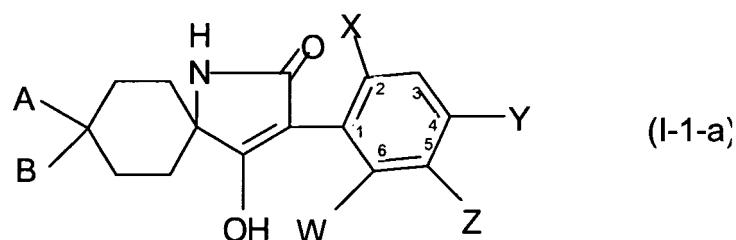
収量：0.25g (=理論値の37%) m.p. 259°。

【0398】

実施例(I-1-a-1)、実施例(I-1-a-2)、実施例(I-1-a-46)と同様にして、及び、当該調製についての一般的な記載に従って、式(I-1-a)の以下の化合物が得られる。

【0399】

【表9】



実施例番号	W	X	Y	Z	A B	m.p. °C	異性体
I-1-a-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	314	α : β 約 19:1
I-1-a-4	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	281	α : β 約 3:7
I-1-a-5	CH ₃	CH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	316	α
I-1-a-6	CH ₃	CH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	289	α : β 約 2:3
I-1-a-7	CH ₃	CH ₃	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	300	α
I-1-a-8	CH ₃	CH ₃	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	273	α : β 約 3:7
I-1-a-9	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	266	α
I-1-a-10	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	261	α : β 約 5:4
I-1-a-11	C ₂ H ₅	OCH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	226	混合物 α + β
I-1-a-12	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	159	α : β 約 1:6
I-1-a-13	Cl	OCH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	216	混合物
I-1-a-14	CH ₃	CH ₃	H	Br	-O-(CH ₂) ₃ -	280	α : β 約 1:4
I-1-a-15	CH ₃	CH ₃	H	Br	-O-(CH ₂) ₃ -	286	α
I-1-a-16	H	CH ₃	Cl	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	270	β
I-1-a-17	H	CH ₃	Cl	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	265	α
I-1-a-18	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	134	α : β 3:7
I-1-a-19	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	271	α
I-1-a-20	Br	Br	OCF ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	油	β
I-1-a-21	Br	Br	OCF ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	275	α
I-1-a-22	CH ₃	CH ₃	▷—	H	-O-(CH ₂) ₃ -	274	α : β 約 7:3
I-1-a-23	CH ₃	CH ₃	▷—	H	-O-(CH ₂) ₃ -	269	α : β 約 1:10
I-1-a-24	CH ₃	CH ₃	J	H	-O-(CH ₂) ₃ -	267	α : β 約 2:1

10

20

30

40

実施例番号	W	X	Y	Z	A B	m.p. °C	異性体
I-1-a-25	CH ₃	CH ₃	J	H	-O-(CH ₂) ₃ -	282	α
I-1-a-26	H	Cl	F	H	-O-(CH ₂) ₃ -	269	混合物
I-1-a-27	H	Cl	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	281	混合物
I-1-a-28	H	CH ₃	H	Br	-O-(CH ₂) ₃ -	油	α + β 約 7 : 2
I-1-a-29	H	CH ₃	H	Br	-O-(CH ₂) ₃ -	261	β
I-1-a-30	H	Br	H	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	236	混合物
I-1-a-31	H	CH ₃	H	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	220	α + β 約 1 : 1
I-1-a-32	H	CH ₃	H	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	234	α
I-1-a-33	H	Cl	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	248	混合物
I-1-a-34	H	CH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	237	α : β 約 1 : 2
I-1-a-35	H	CH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	267	α
I-1-a-36	H	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	244	α : β 約 2 : 1
I-1-a-37	H	CH ₃	F	H	-O-(CH ₂) ₃ -	265	α : β 約 1 : 1
I-1-a-38	H	CH ₃	F	H	-O-(CH ₂) ₃ -	283	α
I-1-a-39	H	CH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	276	α : β 約 1 : 1
I-1-a-40	CH ₃	OCH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	271	β
I-1-a-41	CH ₃	OCH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	268	α
I-1-a-42	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	237	α
I-1-a-43	H	CH ₃	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	225	α
I-1-a-44	H	CH ₃	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	247	β
I-1-a-45	H	CH ₃	H	3,4-F ₂ -Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	256	α : β 約 9 : 1
I-1-a-46	H	CH ₃	H	3-Cl,4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	259	α
I-1-a-47	CH ₃	Cl	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	316-318	β

10

20

30

40

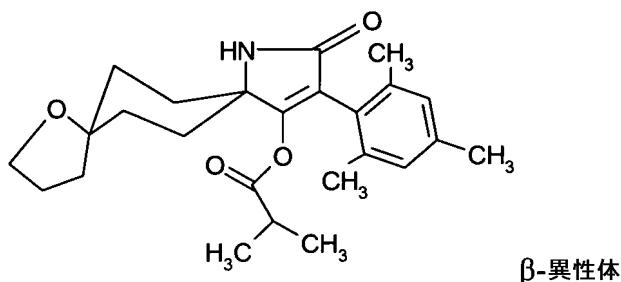
実施例番号	W	X	Y	Z	A	B	m.p. °C	異性体
I-1-a-48	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	301-304		β
I-1-a-49	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	300-302		α
I-1-a-50	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	288-290		β
I-1-a-51	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	220-223		α
I-1-a-52	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	307-310		β
I-1-a-53	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	248-250		α
I-1-a-54	C ₂ H ₅	▷—	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	215-219		α
I-1-a-55	C ₂ H ₅	▷—	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	293-295		β
I-1-a-56	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	202-206		α
I-1-a-57	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	259-263		β
I-1-a-58	CH ₃	Cl	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	291-294		α

【0400】

実施例(I-1-b-1)

【0401】

【化82】



15 mL の酢酸エチル (EA) の中に、最初に、0.512 g (1.5 mmol) の実施例 (I-1-a-4) の化合物を入れ、0.21 mL (1.5 mmol) のトリエチルアミン及び 10 mg の 4-N,N-ジメチルアミノピリジンを添加する。還流下、1.5 mL の EA 中の 0.16 mL (1.5 mmol) の塩化イソブチリルを滴下して加え、得られた混合物をさらに 2 時間攪拌する。冷却後、その混合物を濃縮し、残留物を、シクロヘキサン / アセトン (7 : 3) を用いるシリカゲル MPLC によるクロマトグラフィーに付す。これにより、0.46 g (理論値の 70%) [融点 211] が得られる。

【0402】

実施例 (I-1-b-1) と同様にして、及び、当該調製についての一般的な記載に従って、式 (I-1-b) の以下の化合物が得られる。

【0403】

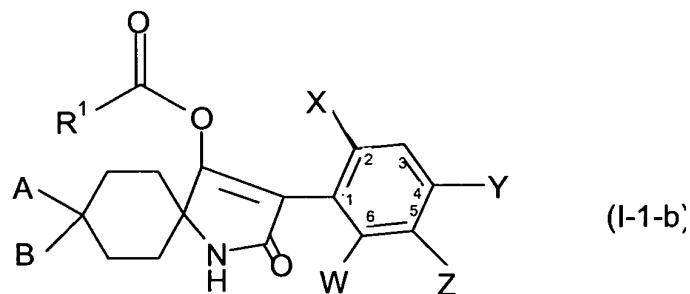
10

20

30

40

【表 10】



実施例番号	W	X	Y	Z	A	B	R ¹	m.p. °C	異性体
I-1-b-2	CH ₃	CH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	241		α : β 約 1:1
I-1-b-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	236		α
I-1-b-4	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	▷	235		α
I-1-b-5	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	▷	236		β
I-1-b-6	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃ O-CH ₂ -	206		α
I-1-b-7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃ O-CH ₂ -	分解		β

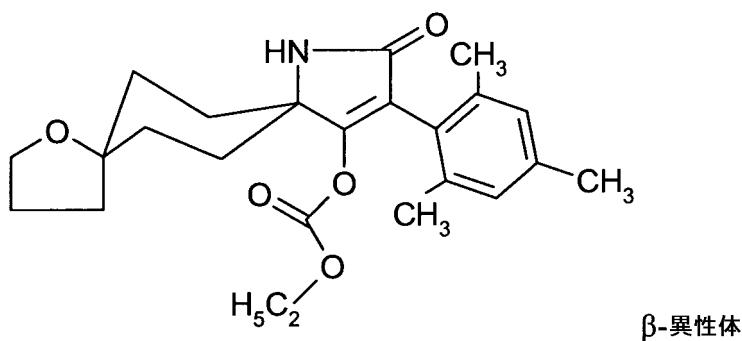
【0404】

30

実施例 (I - 1 - c - 1)

【0405】

【化83】



10 mL のジクロロメタンの中に、最初に、350 mg の実施例 (I - 1 - a - 4) の化合物を入れ、0.14 mL のトリエチルアミンを添加する。室温で、1 mL のジクロロメタン中の0.1 mL のクロロギ酸エチルを滴下して加え、攪拌を2時間続ける。その溶媒を蒸発させ、残留物を、シクロヘキサン / アセトン (7:3) を用いるシリカゲルMP LC によるクロマトグラフィーに付す。得られた画分を濃縮し、取ってメタノールの中に入れる。その生成物を水で沈澱させ、吸引濾過する。収量：0.11 g (理論値の25%) [融点 197]。

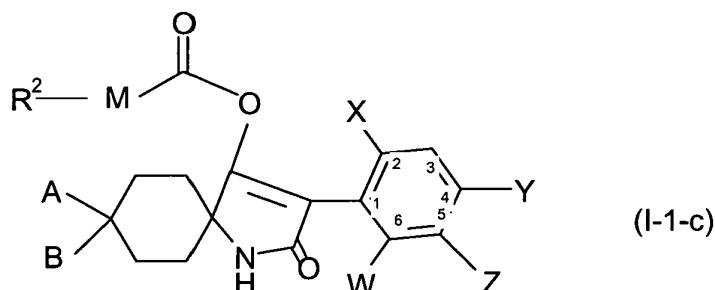
50

【0406】

実施例(I-1-c-1)と同様にして、及び、当該調製についての一般的な記載に従つて、式(I-1-c)の以下の化合物が得られる。

【0407】

【表11】



実施例番号	W	X	Y	Z	A B	M	R ²	m.p. °C	異性体
I-1-c-2	CH ₃	CH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	227	α
I-1-c-3	CH ₃	CH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	208	α : β 約 87:12
I-1-c-4	CH ₃	CH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	*	β
I-1-c-5	CH ₃	CH ₃	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	216	β
I-1-c-6	CH ₃	CH ₃	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	分解	α
I-1-c-7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	220	α
I-1-c-8	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	Ph-CH ₂ -	199	α
I-1-c-9	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	Ph-CH ₂ -	215	β
I-1-c-10	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	175-177	β
I-1-c-11	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	190-193	β
I-1-c-12	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	187-189	β
I-1-c-13	C ₂ H ₅	▷-	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	206-207	β
I-1-c-14	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	172-174	β
I-1-c-15	CH ₃	Cl	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	217-219	β
I-1-c-16	CH ₃	C ₂ H ₅	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	183-185	β

10

20

30

40

実施例番号	W	X	Y	Z	A B	M	R ²	m.p. °C	異性体
I-1-c-17	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	199-201	α
I-1-c-18	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	189-191	α
I-1-c-19	C ₂ H ₅	▷—	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	218-221	α
I-1-c-20	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	211-213	α
I-1-c-21	CH ₃	Cl	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	213-215	α

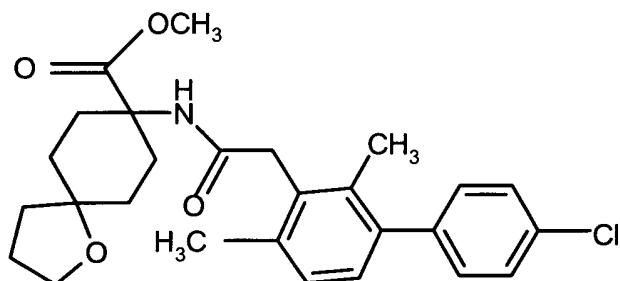
* ¹H-NMR (400MHz, CD₃CN) : δ = 1.01(t, 3H, CO₂CH₂CH₃), 2.11(s, 6H, 2×Ar-CH₃), 3.73(cm, 2H, O-CH₂), 3.97-4.03(q, 2H, CO₂CH₂CH₃) ppm

【0408】

実施例(II-1)

【0409】

【化84】



20mLの酢酸エチルの中に、最初に、2.75gの実施例(XVI-1)の化合物を入れ、0で11mLの水酸化ナトリウム水溶液を添加し、次いで、激しく攪拌しながら、10mLの酢酸エチルに溶解させた2.75gの2,6-ジメチル-3-(4-クロロフェニル)フェニルアセチルクロリドと残りの水酸化ナトリウム水溶液(10mL)を同時に添加する。その反応が完結した後、相を分離させ、その水相を酢酸エチルで抽出する。有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、濃縮する。

MPLC: シクロヘキサン+30-50%酢酸エチル

収率: 2g(理論値の40%)、m.p. 172.8。

【0410】

実施例(II-1)と同様にして、及び、当該調製についての一般的な記載に従って、式(II)の以下の化合物が得られる。

【0411】

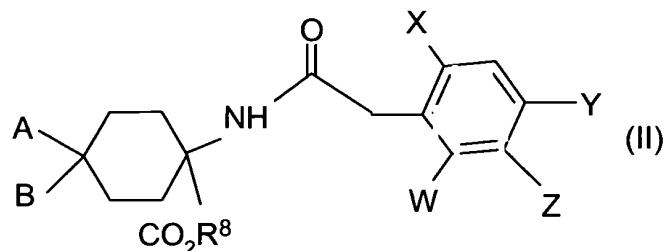
10

20

30

40

【表 1 2】



実施例番号	W	X	Y	Z	A B	R ⁸	m.p. °C	異性体
II-2	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	157	混合物
II-3	CH ₃	CH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	181	混合物
II-4	CH ₃	CH ₃	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	194	混合物
II-5	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	146	混合物
II-6	C ₂ H ₅	OCH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	142	混合物
II-7	H	CH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	149	α : β 約 1:1
II-8	H	Br	H	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	151	α : β 約 1:1
II-9	H	Cl	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	112	α : β 約 1:1
II-10	H	CH ₃	F	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	160	α : β 約 1:1
II-11	H	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	115	α : β 約 1:1
II-12	H	CH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	141	α : β 約 1:1

実施例番号	W	X	Y	Z	A B	R ⁸	m.p. °C	異性体
II-13	H	Cl	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	150	α : β 約 1:1
II-14	H	CH ₃	H	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	160	α : β 約 1:1
II-15	H	CH ₃	H	Br	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	148	α : β 約 1:1
II-16	H	Cl	F	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	145	α : β 約 1:1
II-17	CH ₃	CH ₃	J	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	211	α : β 約 1:1
II-18	CH ₃	▷—	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	188	α : β 約 1:1
II-19	Br	Br	OCF ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	186	α : β 約 1:1
II-20	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	Öl	α : β 約 1:1
II-21	H	CH ₃	Cl	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	161	α : β 約 1:1
II-22	CH ₃	CH ₃	H	Br	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	177	α : β 約 1:1
II-23	Cl	OCH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	162	α : β 約 1:1
II-24	CH ₃	OCH ₃	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	170	α : β 約 1:1
II-25	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	166	α : β 約 1:1

10

20

30

40

実施例番号	W	X	Y	Z	A B	R ⁸	m.p. °C	異性体
II-26	CH ₃	Cl	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	156-158	混合物
II-27	H	C ₂ H ₅	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	98-100	混合物
II-28	C ₂ H ₅	▷	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	154-156	混合物
II-29	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	131-135	混合物
II-30	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	136-138	混合物
II-31	CH ₃	C ₂ H ₅	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	CH ₃	160-162	混合物

【0412】

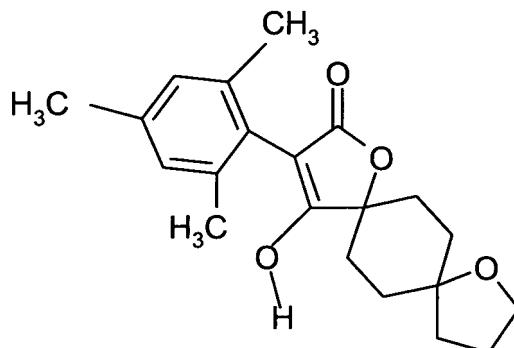
実施例(I-2-a-1)

【0413】

【化85】

10

20



30

280mg(0.72mmol)の実施例(I-II-1)の化合物を5mLのDMFに溶解させ、121mg(1.08mmol)のカリウムtert-ブトキシドを添加し、得られた混合物を室温で8時間攪拌する。その混合物をロータリーエバポレーターを用いて濃縮し、残留物を水とMTBエーテルの間で分配させる。その水相を塩酸で酸性化し、生成物をジクロロメタンで抽出する。有機相を脱水し、濃縮する。

収量 250mg(定量的) [約1:1のシス/トランス異性体混合物として]

NMR(400MHz CDCl₃): δ = 1.5-2.4(m, 12H), 2.2(s, 6H), 2.3(s, 3H), 3.85(m, 2H), 6.9(s, 2H) ppm.

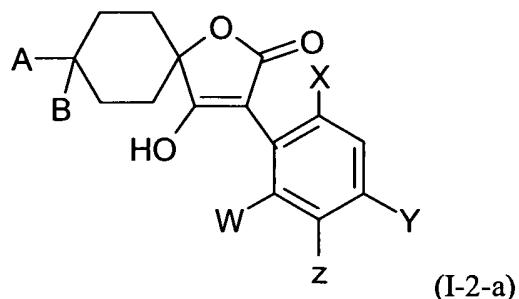
【0414】

40

実施例(I-2-a-1)と同様にして、及び、当該調製についての一般的な記載に従って、式(I-2-a)の以下の化合物が得られる。異性体の単離は、によって行った。

【0415】

【表 1 3】



実施例番号	W	X	Y	Z	A B	$\log P^*$	異性体
I-2-a-2	H	CH ₃	H	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	2.73	α
I-2-a-3	H	CH ₃	H	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	2.29	β
I-2-a-4	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.52	β
I-2-a-5	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	3.00	α
I-2-a-6	CH ₃	C ₂ H ₅	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	3.44	α
I-2-a-7	CH ₃	C ₂ H ₅	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.94	β
I-2-a-8	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	3.09	β
I-2-a-9	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	3.62	α
I-2-a-10	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.28	β
I-2-a-11	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.66	α
I-2-a-12	H	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.74	β

10

20

30

40

実施例番号	W	X	Y	Z	A B	log P*	異性体
I-2-a-13	H	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	4.24	α
I-2-a-14	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.73	β
I-2-a-15	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	3.21	α
I-2-a-16	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.99	β
I-2-a-17	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	3.47	α
I-2-a-18	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.52	β
I-2-a-19	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	4.06	α
I-2-a-20	H	Cl	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.25	β
I-2-a-21	H	Cl	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.79	α
I-2-a-22	H	CH ₃	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.0	β
I-2-a-23	H	CH ₃	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.5	α
I-2-a-24	H	CH ₃	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.32	β
I-2-a-25	H	CH ₃	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.87	α
I-2-a-26	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	4.15	α
I-2-a-27	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.60	β
I-2-a-28	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.73	α

10

20

30

40

実施例番号	W	X	Y	Z	A B	log P*	異性体
I-2-a-29	C ₂ H ₅	CH ₃	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	3.22	α
I-2-a-30	H	CH ₃	Br	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	3.28	α
I-2-a-31	H	CH ₃	Br	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	2.77	β
I-2-a-32	CH ₃	Br	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.48	β
I-2-a-33	CH ₃	Br	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.95	α
I-2-a-34	CH ₃	OCH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.05	β
I-2-a-35	CH ₃	OCH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.42	α
I-2-a-36	C ₂ H ₅	Cl	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.77	β
I-2-a-37	C ₂ H ₅	Cl	Br	H	-O-(CH ₂) ₃ -	3.40	α
I-2-a-38	Cl	Br	C ₂ H ₅	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.79	β
I-2-a-39	Cl	Br	C ₂ H ₅	H	-O-(CH ₂) ₃ -	3.26	α
I-2-a-40	H	Cl	Cl	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	2.60	β
I-2-a-41	H	Cl	Cl	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	3.14	α
I-2-a-42	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.79	β
I-2-a-43	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	4.32	α
I-2-a-44	CH ₃	C ₂ H ₅	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	2.82	β

10

20

30

40

実施例番号	W	X	Y	Z	A B	$\log P^*$	異性体
I-2-a-45	CH ₃	C ₂ H ₅	Cl	H	-O-(CH ₂) ₃ -	3.34	α
I-2-a-46	CH ₃	CH ₃	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.69	α
I-2-a-47	CH ₃	CH ₃	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.20	β
I-2-a-48	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	2.99	α
I-2-a-49	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	2.54	β
I-2-a-50	H	Cl	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	2.91	β
I-2-a-51	H	Cl	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	3.42	α

10

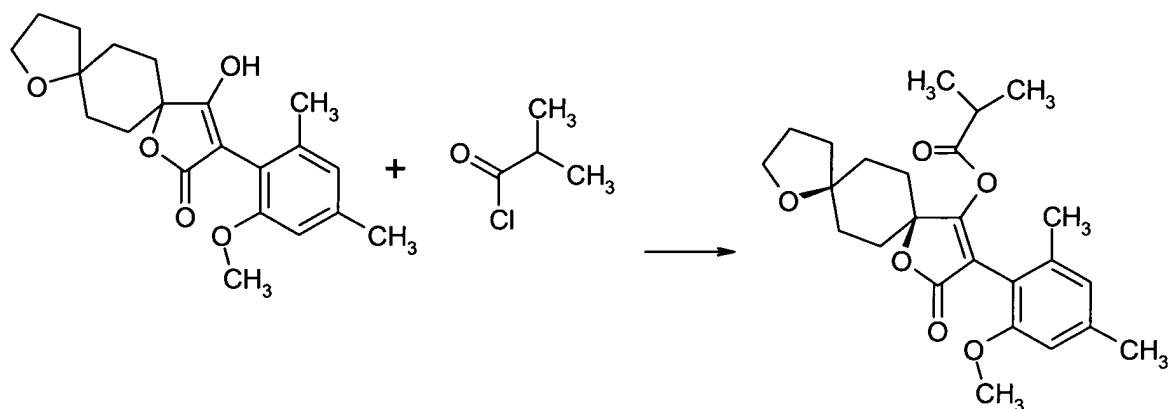
20

【0416】

実施例(I-2-b-1)

【0417】

【化86】



30

204mg (0.569mmol) の化合物(I-2-a-10)と化合物(I-2-a-11)のシス/トランス混合物を10mLのジクロロメタンに溶解させ、69mg (0.683mmol) のトリエチルアミンを添加し、及び、73mg (0.683mmol) の塩化イソブチリルを室温で滴下して加える。室温で16時間攪拌した後、その混合物を濃縮し、シリカゲルクロマトグラフィー(ジクロロメタン/アセトン 100:10)で精製する。

収量：51mg のシス異性体(I-2-b-1)（理論値の21%）

1.0g P: 4.12。

【0418】

実施例(I-2-b-1)と同様にして、及び、当該調製についての一般的な記載に従

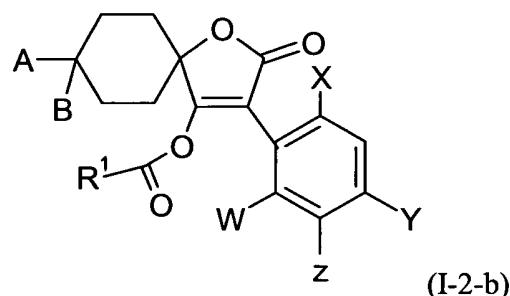
40

50

つて、式(I-2-b)の以下の化合物が得られる。

【0419】

【表14】



実施例番号	W	X	Y	Z	A	B	R ¹	log P*	異性体
I-2-b-2	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇		4.60	α
I-2-b-3	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇		5.64	β
I-2-b-4	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇		6.24	α
I-2-b-5	H	CH ₃	H	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇		4.22	β
I-2-b-6	H	CH ₃	H	CH ₃	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇		4.78	α
I-2-b-7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇		4.52	β
I-2-b-8	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇		5.12	α
I-2-b-9	H	CH ₃	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇		4.83	β
I-2-b-10	H	CH ₃	H	4-F-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇		5.38	α

10

20

30

40

実施例番号	W	X	Y	Z	A B	R ¹	log P*	異性体
I-2-b-11	H	CH ₃	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	5.86	α
I-2-b-12	H	Cl	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	5.26	β
I-2-b-13	H	CH ₃	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	5.29	β
I-2-b-14	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	t-C ₄ H ₉	4.96	β
I-2-b-15	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₉	5.63	β
I-2-b-16	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl-Ph	-O-(CH ₂) ₃ -	t-C ₄ H ₉	6.09	β
I-2-b-17	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	t-C ₄ H ₉	5.58	α
I-2-b-18	CH ₃	OCH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	3.75	β
I-2-b-19	CH ₃	OCH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	t-C ₄ H ₉	4.16	β
I-2-b-20	CH ₃	OCH ₃	H	H	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	4.25	α
I-2-b-21	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	t-C ₄ H ₉	4.50	β
I-2-b-22	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	5.17	β
I-2-b-23	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	t-C ₄ H ₉	5.62	β
I-2-b-24	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	i-C ₃ H ₇	5.79	α
I-2-b-25	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	t-C ₄ H ₉	6.25	α

【 0 4 2 0 】

実施例 (I - 2 - c - 1)

【 0 4 2 1 】

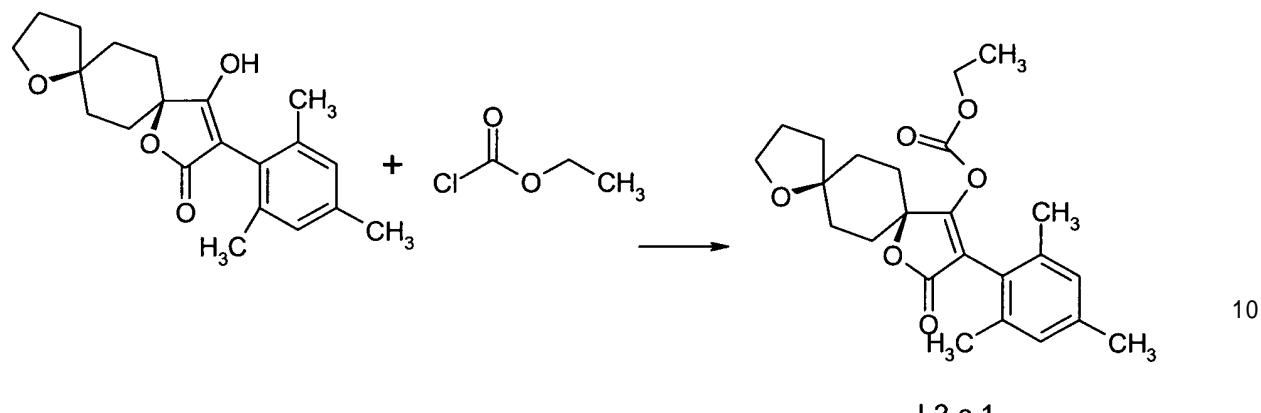
10

20

30

40

【化 8 7】



100 mg (0.292 mmol) の実施例 (I-2-a-4) の化合物を 5 mL のジクロロメタンに溶解させ、35 mg (0.350 mmol) のトリエチルアミンを添加し、及び、38 mg (0.350 mmol) のクロロギ酸エチルを室温で滴下して加える。室温で 16 時間攪拌した後、その混合物を濃縮し、RP-18シリカゲル上の分取 HPLC (アセトニトリル / 水) で精製する。

収量：64 mg (I-2-c-1) (理論値の 53%)

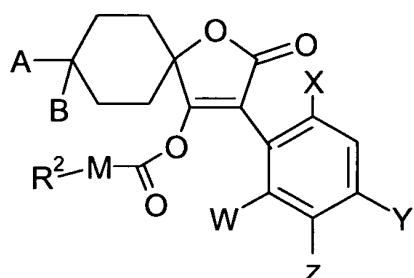
log P : 4.09.

【0422】

実施例 (I-2-c-1) と同様にして、及び、当該調製についての一般的な記載に従って、式 (I-2-c) の以下の化合物が得られる。

【0423】

【表 15】



(I-2-c)

実施例 番号	W	X	Y	Z	A B	M	R ²	log P*	異性体
I-2-c-2	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	4.69	α
I-2-c-3	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	4.68	β
I-2-c-4	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-O-(CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	5.28	α

【0424】

10

20

30

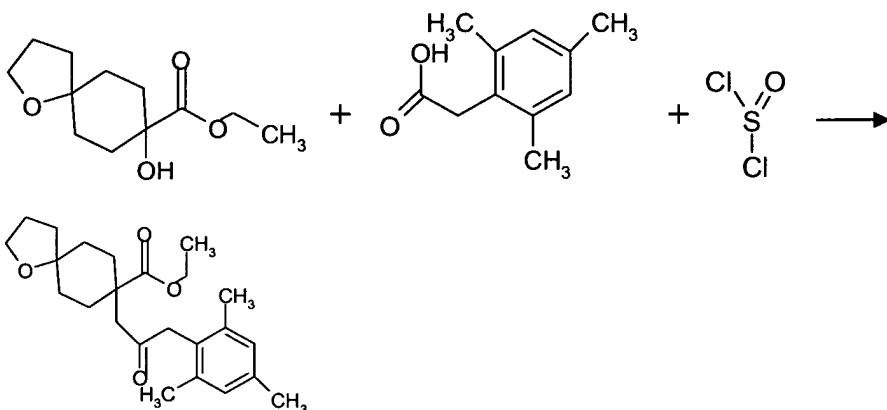
40

50

実施例(III-1)

【0425】

【化88】



III-1

10 mLのトルエンの中に、最初に、178 mg (1.0 mmol) の2,4,6-トリメチルフェニル酢酸を入れ、238 mg (2.0 mmol) の塩化チオニル及び1滴のD M Fを添加する。その混合物を90で1時間攪拌し、冷却し、ロータリーエバポレーターを用いて濃縮する。残留物を5 mLのトルエンに溶解させ、228 mg (1.0 mmol) の実施例(XXII-1)のヒドロキシエステルを添加する。その混合物を90で8時間攪拌し、冷却し、ロータリーエバポレーターを用いて濃縮する。得られた粗製生成物を、5%強度水酸化ナトリウム水溶液とMTBエーテルの間で分配させることによって精製する。その有機相を脱水し、濃縮する。

収量：280 mg の油状物（理論値の72%）

D M F = N,N-ジメチルホルムアミド。

【0426】

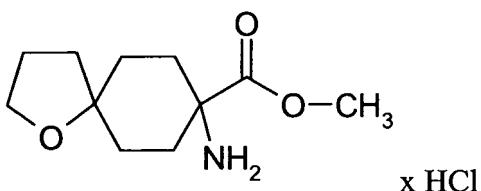
その油状物は、それ以上精製することなく、実施例(I-2-a-1)の合成に使用する。

【0427】

実施例(XVII-1)

【0428】

【化89】



アルゴン下、0から5で、880 mLのメタノールの中に、最初に、35 gの実施例(XIX-1)の化合物を入れる。15.2 mLの塩化チオニルを滴下して加え、得られた混合物を0で30分間攪拌し、及び、透明な溶液が形成されるまで40で8時間攪拌する。次いで、その溶液を5に冷却し、沈澱物を吸引濾過する。その溶液をロータリーエバポレーターを用いて濃縮する。

収量：31 g（理論値の84%）

¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO) : δ = 1.52 - 1.68 (m, 5H, CH₂), 1.81 - 2.00 (m, 6H, CH₂), 2.07 - 2.14 (m, 1H, CH₂), 3.68 - 3.72 (m, 2H, OCH₂), 3.74 (s, 3H, OCH₃)

10

20

30

40

50

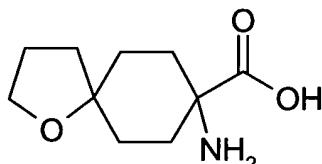
) p.p.m.

【0429】

実施例(XIX-1)

【0430】

【化90】



10

アルゴン下、33.3 g の実施例(XXIII-1)の化合物を167 mL の30%強度KOHに懸濁させ、得られた混合物を還流温度で一晩攪拌する。

【0431】

その混合物を、ロータリーエバポレーターを用いてその体積の約25%まで濃縮し；0-10で、濃HClを用いてpHを2に調節する。その溶液をロータリーエバポレーターを用いて濃縮し、脱水する。残留物をエステル化に直接使用して、(XVII-1)を得る。

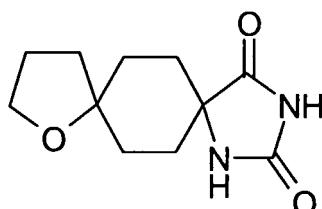
【0432】

実施例(XXIII-1)

20

【0433】

【化91】



290 mL の水の中に、最初に、炭酸アンモニウム(65 g)及びシアン化ナトリウム(8.7 g)を入れる。室温で出発して、25 g の1-オキサスピロ-[4,5]-デカン-8-オン(DE 3241933 A1、US 4438130 A、WO 92/06094、WO 94/11374から既知)を滴下して加え、得られた反応混合物を55から60で4時間攪拌し、50 mLまで濃縮し、次いで、0から5で2時間攪拌し、約-2で吸引濾過する。その残留物を少量の氷水で洗浄し、乾燥させる。

収量：33.3 g (理論値の91%)；¹H-NMR(400 MHz, d₆-DMSO)：=1.36-1.39(d m, 1 H, CH₂), 1.58-1.72(m, 8 H, CH₂), 1.81-1.87(m, 2 H, CH₂), 1.88-2.02(m, 1 H, CH₂), 3.69-3.72(t, 2 H, OCH₂), 8.04, 8.19(2 s, 1 H, NH-C), 10.31(s, 1 H, CO-NH-CO) p.p.m.

30

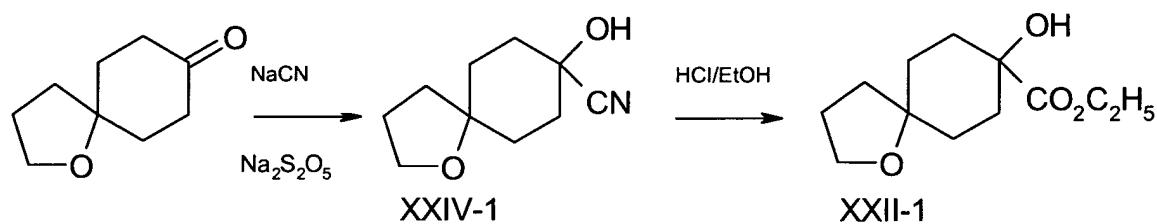
【0434】

8-ヒドロキシ-1-オキサスピロ[4,5]デカン-8-カルボン酸エチル(XXI-I-1)の合成

【0435】

40

【化92】



【0436】

実施例 (XXIV-1)

35 g (713 mmol) のシアノ化ナトリウムを 400 mL の水に溶解させ、20 - 28 度、100 g (648 mmol) の 1 - オキサスピロ - [4,5] - デカン - 8 - オンを 30 分間かけて滴下して加え、次いで、80 g $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_5$ (421 mmol) の溶液を添加し、得られた混合物を室温で一晩攪拌する。

【0437】

後処理のために、その混合物をそれぞれ 300 mL のトルエンで 3 回抽出し、その有機相をロータリーエバポレーターを用いて濃縮する。

収量：107 g のシアノヒドリン（理論値の 91%）(XXIV-1)。 20

【0438】

実施例 (XXII-1)

段階 1 からの 107 g (236 mmol) のシアノヒドリン (XXIV) を 400 mL のエタノールに溶解させ、-20 度、塩化水素を 5 時間かけて導入する（その混合物は、-5 度までゆっくりと昇温する。）。その混合物を室温で一晩攪拌する。

【0439】

後処理のために、45 度以下で減圧下に溶媒を留去し、400 mL の氷水を添加し、得られた混合物を 3 時間攪拌する。その混合物をそれぞれ 300 mL のジクロロメタンで 3 回抽出する。その有機相を重炭酸ナトリウム溶液で洗浄し、ロータリーエバポレーターを用いて濃縮し、高真空下で蒸留する (0.08 mbarr で b.p. 116)。 30

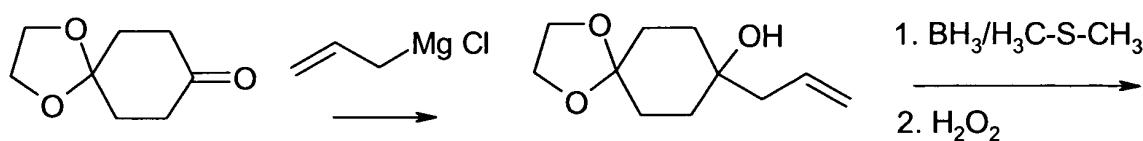
収量：55.7 g のヒドロキシエステル（理論値の 41%）(XXII-1)。

【0440】

1 - オキサスピロ - [4,5] - デカン - 8 - オンの調製 (E)

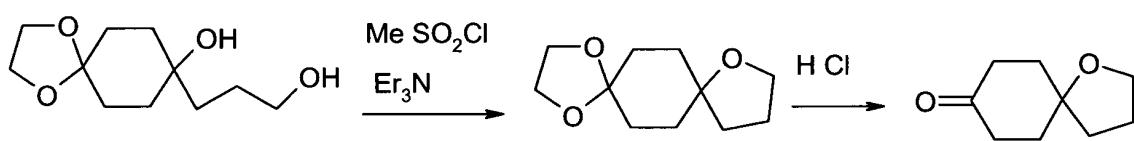
【0441】

【化93】



A

B



C

D

E

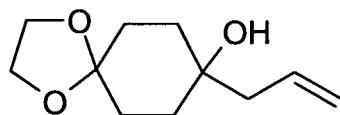
50

【0442】

Bの調製：

【0443】

【化94】



室温で、1.8 mL (3.6 mol) のアリルマグネシウムクロリド (THF 中 2 M) を最初に入れる。3000 mL の THF 中の 467 g (3 mol) の 1,4-シクロヘキサンジオンモノエチレンケタールの溶液を滴下して加える。添加が完了した後、その反応混合物をしばらくの間加熱還流し、次いで、0 まで冷却する。約 300 mL の水を注意深く滴下して加える。次いで、セライトを添加し、得られた混合物を 1 時間攪拌する。次いで、その反応混合物を濾過フィルター (nutzsch filter) 上でセライトを通して濾過し、その濾液をロータリーエバボレーターを用いて濃縮する。精製するために、その生成物を、オイルポンプを用いた減圧下にブリッジを冷却することなく蒸留する。先端部の温度は 81 - 83 であった。

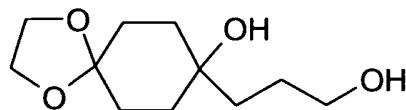
収量：485 g (= 理論値の 81 %)。

【0444】

Cの調製：

【0445】

【化95】



0 で、3675 mL の THF 中の 485.1 g (2.45 mol) の化合物 B の溶液に、225.4 g (2.94 mol) のボラン / ジメチルスルフィド錯体を滴下して加える。次いで、その反応混合物を室温で一晩攪拌する。次いで、0 、その反応混合物に、1225 mL の水、980 mL の 3 M NaOH 及び 980 mL の過酸化水素 (水の中の 30% 強度) を順次滴下して加える。その水相をメチル tert - プチルエーテル (MTE) で 3 回抽出し、有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水する。その乾燥剤を分離除去し、次いで、溶媒を除去する。得られた生成物は、それ以上精製することなく反応させる。

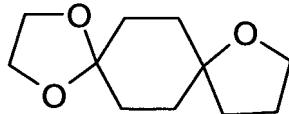
収量：275 g (= 理論値の 52 %)。

【0446】

Dの調製：

【0447】

【化96】



0 で、3175 mL のジクロロメタン中の 274.3 g (1.27 mol) の化合物 C と 294.6 g (2.92 mol) のトリエチルアミンの溶液を最初に入れる。その溶液に、1270 mL のジクロロメタン中の 160 g (1.4 mol) の塩化メタンスルホニルをゆっくりと滴下して加える。添加が完了した後、その混合物を一晩攪拌する。その

10

20

30

40

50

有機相を、水で1回洗浄し、炭酸カリウム溶液で1回洗浄し、希HClで1回洗浄し、次いで、硫酸ナトリウムで脱水する。その乾燥剤を分離除去し、次いで、溶媒を除去する。得られた生成物は、精製するために、オイルポンプを用いた減圧下に蒸留する（先端部の温度68-72）。

収量：101g（=理論値の40%）。

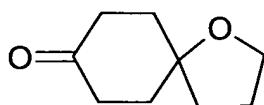
【0448】

Eの調製：

【0449】

【化97】

10



80で、408mLのTHF中の101g（0.51mol）の化合物Dを428mLの希HCl（326mLの水と102mLの濃HCl）の中で一晩攪拌する。その反応の進行をモニターし、出発物質がそれ以上検出されなくなったら、その反応混合物の溶媒を留去し、次いで、その混合物をクロロホルムで3回抽出する。有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水する。その乾燥剤を分離除去し、次いで、溶媒を除去する。得られた生成物は、精製するために、オイルポンプを用いた減圧下に蒸留する（先端部の温度56-58）。

収量：56g（=理論値の71%）。

【0450】

1ogP値の測定

上記表中に記載されている1ogP値は、EEC Directive 79/831 Annex V.A8に従い、逆相カラム（C18）でのHPLC（高性能液体クロマトグラフィー）により測定した。

温度：55。

酸性範囲（pH3.4）における測定のための移動相：

移動相A：アセトニトリル+ギ酸（1mL/L）；

移動相B：水+ギ酸（0.9mL/L）

勾配：4.25分間かけて、「10%移動相A/90%移動相B」から「95%移動相A/5%移動相B」まで。

【0451】

校正は、1ogP値が知られている非分枝鎖アルカン-2-オン（炭素原子数3から16）を用いて行った（その1ogP値は、連続する2種類のアルカノンの間の線形補間を用いて、保持時間により決定）。ラムダマックス値は、200nmから400nmの紫外線スペクトルを用いて、クロマトグラフシグナルの最大値で決定した。

【0452】

使用実施例

実施例1

1. 発生前除草効果

木質纖維製ポット内の砂壤土に单子葉植物及び双子葉植物の雑草植物と作物植物の種子を配置し、土壤で被覆する。次いで、その被覆した土壤の表面に、水和剤（WP）又は乳剤（emulsion concentrate）（EC）の形態に製剤した被験化合物を、種々の薬量で、0.2%の湿潤剤を添加した600L/ha（変換）の施用水量の水性懸濁液又はエマルションとして施用する。処理後、ポットを温室内に置き、その被験植物にとって良好な成育条件下に維持する。3週間の試験期間が経過した後、未処理対照と比較することにより、当該被験植物に対するダメージを視覚的に評価する（除草活性（%）：100%の活性=植物の枯死、0%の活性=対照植物と同様）。

10

20

30

40

50

【0453】

320 g (a.i.) / haで発生前方法によって施用された場合、以下の化合物は、イヌビエ (*Echinocloa crus-galli*)、イタリアンライグラス (*Lolium multiflorum*) 及びエノコログサ (*Setaria viridis*) に対して、80%以上の活性を示す：

実施例 I - 1 - a - 2、I - 1 - a - 4、I - 1 - a - 8、I - 1 - a - 10、I - 1 - a - 11、I - 1 - a - 12、I - 1 - a - 13、I - 1 - a - 40、I - 1 - a - 49、I - 1 - a - 51、I - 1 - a - 54、I - 1 - a - 55、I - 1 - b - 1、I - 1 - b - 5、I - 1 - b - 7、I - 2 - b - 1、I - 2 - b - 2、I - 1 - c - 1、I - 1 - c - 11、I - 1 - c - 12、I - 1 - c - 13、I - 1 - c - 15、I - 1 - c - 16、I - 1 - c - 18、I - 1 - c - 19。 10

【0454】2. 発生後除草効果

木質纖維製ポット内の砂壌土に単子葉植物及び双子葉植物の雑草植物と作物植物の種子を配置し、土壤で被覆し、良好な成育条件下に温室内で栽培する。播種後2から3週間経過した後、被験植物を1葉期で処理する。次いで、当該植物の緑色の部分に、水和剤 (WP) 又は乳剤 (emulsion concentrate) (EC) として製剤した被験化合物を、種々の薬量で、0.2%の湿潤剤を添加した600 L / ha (変換) の施用水量で、散布する。該被験植物を、最適な成育条件下で、約3週間温室内に維持した後、該調製物の活性について、未処理対照との比較で視覚的に評価する (除草活性 (%)) : 100%の活性 = 植物の枯死、0%の活性 = 対照植物と同様)。 20

【0455】

80 g (a.i.) / haで発生後方法によって施用された場合、以下の化合物は、ノスズメノテッポウ (*Alopecurus myosuroides*)、イヌビエ (*Echinocloa crus-galli*)、イタリアンライグラス (*Lolium multiflorum*) 及びエノコログサ (*Setaria viridis*) に対して、90%以上の活性を示す：

実施例 I - 1 - a - 10、I - 1 - a - 11、I - 1 - a - 12、I - 1 - a - 49、I - 1 - a - 51。

【0456】

80 g (a.i.) / haで発生後方法によって施用された場合、以下の化合物は、ノスズメノテッポウ (*Alopecurus myosuroides*)、イヌビエ (*Echinocloa crus-galli*)、イタリアンライグラス (*Lolium multiflorum*) 及びエノコログサ (*Setaria viridis*) に対して、%以上の活性を示す： 30

実施例 I - 1 - a - 4、I - 1 - a - 54、I - 1 - a - 58、I - 1 - c - 10、I - 1 - c - 11、I - 1 - c - 12、I - 1 - c - 13、I - 1 - c - 14。

【0457】実施例 2発生後除草効果

木質纖維製ポット内又はプラスチック製ポット内の砂壌土に単子葉植物及び双子葉植物の雑草植物と作物植物の種子を配置し、土壤で被覆し、良好な成育条件下に温室内で栽培する (生育期間中は、屋外、温室外でも栽培する。)。播種後2から3週間経過した後、被験植物を1から3葉期で処理する。水和剤 (WP) 又は液剤 (EC) として製剤した被験化合物を、種々の薬量で、湿潤剤 (0.2%から0.3%) を添加した300 L / ha (変換) の施用水量で、当該植物及び当該土壤の表面に散布する。被験植物を処理してから3から4週間経過した後、当該調製物の効果について、未処理対照との比較で視覚的に評価する (除草活性 (%)) : 100%の活性 = 植物の枯死、0%の活性 = 対照植物と同様)。 40

【0458】薬害軽減剤の使用：

さらに、作物植物の場合に、薬害軽減剤が被検物質の植物適合性を改善し得るか否かについても試験する場合、該薬害軽減剤の施用について以下のオプションを使用する： 50

- 作物植物の種子を、播種前に、薬害軽減物質で粉衣する（薬害軽減剤の量は、当該種子の重量を基準とした百分率で示す。）；
- 被験物質を施用する前に、作物植物に薬害軽減剤を1ヘクタール当たりの特定の施用量で散布する（通常、被験物質を施用する1日前）；
- 薬害軽減剤を被験物質と一緒にタンクミックスとして施用する（薬害軽減剤の量は、g / haで示すか、又は、除草剤を基準とした比率で示す。）。

【0459】

禾穀類を用いた温室内容器試験

除草剤を施用する1日前にメフェンピル

【0460】

【表16】

10

施用の28日後		
	施用量 g(a. i.)/ha	夏小麦 測定値 (%)
実施例 (I-1-a-11)	100	95
	50	80
	25	70
	12.5	65
実施例 (I-1-a-11) + メフェンピル	100 + 50	80
	50 + 50	40
	25 + 50	30
	12.5 + 50	10

20

【0461】

【表17】

施用の10日後

施用の10日後		
	施用量 g(a. i.)/ha	夏大麦 測定値 (%)
実施例 (I-1-a-13)	50	30
	25	20
	12.5	20
実施例 (I-1-a-13) + メフェンピル	50 + 50	10
	25 + 50	2
	12.5 + 50	0

30

【0462】

【表18】

施用の28日後		
	施用量 g(a. i.)/ha	夏小麦 測定値 (%)
実施例 (I-1-a-13)	100	50
	50	30
	25	10
実施例 (I-1-a-13) + メフェンビール	100 + 50	30
	50 + 50	10
	25 + 50	5

【0463】

【表19】

施用の28日後		
	施用量 g(a. i.)/ha	夏小麦 測定値 (%)
実施例 (I-1-b-7)	100	60
	50	50
	25	10
実施例 (I-1-b-7) + メフェンビール	100 + 50	5
	50 + 50	5
	25 + 50	2

【0464】

実施例3

30

ファエドン (Phaedon) 試験 (P H A E C O 噴霧処理)

溶媒 : 78.0 重量部のアセトン

1.5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤 : 0.5 重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

【0465】

活性化合物の適切な調製物を調製するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤を含有している水で稀釀して所望の濃度とする。

【0466】

ハクサイ (Brassica pekinensis) のディスクに所望の濃度を有する活性化合物調製物を噴霧し、乾燥後、マスタードビートル (mustard beetle) (Phaedon cochleariae) の幼虫を寄生させる。

40

【0467】

所望の期間が経過した後、効果(%)を求める。100%は、全てのマスタードビートル幼虫が死んだことを意味し、0%は、死んだマスタードビートル幼虫が無かったことを意味する。

【0468】

この試験において、例えば、調製実施例の以下の化合物は、500 g / haの施用量で80%以上の効力を示す：

実施例番号 I - 1 - a - 3、I - 1 - a - 4、I - 1 - a - 5、I - 1 - a - 6、I - 1

50

- a - 1 3 、 I - 1 - a - 1 8 、 I - 1 - a - 2 3 、 I - 1 - a - 4 1 、 I - 1 - a - 4 3 、 I - 1 - a - 4 4 、 I - 1 - a - 4 5 、 I - 1 - a - 4 6 、 I - 1 - a - 4 8 、 I - 1 - a - 4 9 、 I - 1 - a - 5 1 、 I - 1 - a - 5 4 、 I - 1 - a - 5 6 、 I - 1 - a - 5 8 、 I - 1 - b - 1 、 I - 1 - b - 7 、 I - 1 - c - 1 、 I - 1 - c - 1 2 、 I - 1 - c - 1 5 、 I - 1 - c - 2 1 、 I - 2 - a - 3 、 I - 2 - a - 4 、 I - 2 - a - 1 4 、 I - 2 - a - 1 8 、 I - 2 - a - 2 1 、 I - 2 - a - 2 2 、 I - 2 - a - 2 3 、 I - 2 - a - 2 4 、 I - 2 - a - 2 5 、 I - 2 - a - 3 2 、 I - 2 - a - 4 2 、 I - 2 - a - 4 4 、 I - 2 - a - 4 7 、 I - 2 - a - 4 9 、 I - 2 - b - 1 、 I - 2 - b - 5 、 I - 2 - b - 7 、 I - 2 - b - 1 5 、 I - 2 - b - 2 1 、 I - 2 - c - 1 、 I - 2 - c - 2 。

【 0 4 6 9 】

10

実施例 4ツマジロクサヨトウ (Spodoptera frugiperda) 試験 (噴霧処理)

溶媒 : 7 8 . 0 重量部のアセトン

1 . 5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤 : 0 . 5 重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

【 0 4 7 0 】

活性化合物の適切な調製物を調製するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤を含有している水で稀釈して所望の濃度とする。

【 0 4 7 1 】

20

トウモロコシ (Zea mays) の葉のディスクに、所望の濃度を有する活性化合物調製物を噴霧し、乾燥後、ツマジロクサヨトウ (army worm) (Spodoptera frugiperda) の幼虫を寄生させる。

【 0 4 7 2 】

所望の期間が経過した後、効果 (%) を求める。100%は、全ての幼虫が死んだことを意味し、0%は、死んだ幼虫が無かったことを意味する。

【 0 4 7 3 】

この試験において、例えば、調製実施例の以下の化合物は、500 g / ha の施用量で80%以上の抗力を示す :

実施例番号 I - 1 - a - 1 、 I - 1 - a - 2 、 I - 1 - a - 3 、 I - 1 - a - 4 、 I - 1 - a - 3 4 、 I - 1 - a - 3 6 、 I - 1 - a - 4 3 、 I - 1 - a - 5 8 、 I - 1 - b - 7 、 I - 1 - c - 1 、 I - 1 - c - 2 、 I - 1 - c - 3 、 I - 1 - c - 4 、 I - 2 - a - 4 、 I - 2 - a - 1 8 、 I - 2 - a - 3 2 、 I - 2 - b - 1 5 、 I - 2 - b - 1 6 。

30

【 0 4 7 4 】

実施例 5テトラニクス (Tetranychus) 試験 , O P - 抵抗性 (T E T R U R 噴霧処理)

溶媒 : 7 8 . 0 重量部のアセトン

1 . 5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤 : 0 . 5 重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

【 0 4 7 5 】

40

活性化合物の適切な調製物を調製するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤を含有している水で稀釈して所望の濃度とする。

【 0 4 7 6 】

全ての成育段階のナミハダニ (greenhouse red spider mite) (Tetranychus urticae) が寄生しているインゲンマメ (Phaseolus vulgaris) の葉のディスクに、所望の濃度を有する活性化合物調製物を噴霧する。

【 0 4 7 7 】

所望の期間が経過した後、効果 (%) を求める。100%は、全てのナミハダニが死んだことを意味し、0%は、死んだナミハダニが無かったことを意味する。

50

【0478】

この試験において、例えば、調製実施例の以下の化合物は、100g/haの施用量で80%以上の効力を示す：

実施例番号 I - 1 - a - 1、I - 1 - a - 2、I - 1 - a - 3、I - 1 - a - 4、I - 1 - a - 11、I - 1 - a - 13、I - 1 - a - 20、I - 1 - a - 27、I - 1 - a - 40、I - 1 - a - 41、I - 1 - a - 44、I - 1 - a - 46、I - 1 - b - 1、I - 1 - b - 3、I - 1 - b - 6、I - 1 - b - 7、I - 1 - c - 2、I - 1 - c - 21、I - 2 - a - 1、I - 2 - a - 4、I - 2 - a - 5、I - 2 - a - 6、I - 2 - a - 10、I - 2 - a - 12、I - 2 - a - 16、I - 2 - a - 18、I - 2 - a - 20、I - 2 - a - 21、I - 2 - a - 23、I - 2 - a - 24、I - 2 - a - 25、I - 2 - a - 26、I - 2 - a - 42、I - 2 - a - 43、I - 2 - a - 47、I - 2 - a - 51、I - 2 - b - 2、I - 2 - b - 5、I - 2 - b - 7、I - 2 - b - 8、I - 2 - b - 11、I - 2 - b - 14、I - 2 - b - 15、I - 2 - b - 16、I - 2 - b - 22、I - 2 - b - 23、I - 2 - b - 24、I - 2 - b - 25、I - 2 - c - 1、I - 2 - c - 2、I - 2 - c - 3、I - 2 - c - 4；
10

この試験において、例えば、調製実施例の以下の化合物は、500g/haの施用量で80%以上の効力を示す：

実施例番号 I - 1 - a - 9、I - 1 - a - 10、I - 1 - c - 2、I - 1 - c - 3、I - 1 - c - 4、I - 2 - a - 50。

【0479】

20

実施例6**ミズス (Myzus) 試験 (MYZUPE 噴霧処理)**

溶媒： 78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： 0.5重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

【0480】

活性化合物の適切な調製物を調製するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤を含有している水で稀釈して所望の濃度とする。

【0481】

30

全ての成育段階のモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が寄生しているハクサイ (*Brassica pekinensis*) のディスクに、所望の濃度を有する活性化合物調製物を噴霧する。

【0482】

所望の期間が経過した後、効果(%)を求める。100%は、全てのアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだアブラムシが無かったことを意味する。

【0483】

この試験において、例えば、調製実施例の以下の化合物は、500g/haの施用量で80%以上の効果を示す：

実施例番号 I - 1 - a - 1、I - 1 - a - 2、I - 1 - a - 3、I - 1 - a - 4、I - 1 - a - 5、I - 1 - a - 6、I - 1 - a - 7、I - 1 - a - 8、I - 1 - a - 9、I - 1 - a - 11、I - 1 - a - 12、I - 1 - a - 13、I - 1 - a - 14、I - 1 - a - 15、I - 1 - a - 16、I - 1 - a - 17、I - 1 - a - 18、I - 1 - a - 19、I - 1 - a - 20、I - 1 - a - 21、I - 1 - a - 22、I - 1 - a - 23、I - 1 - a - 24、I - 1 - a - 25、I - 1 - a - 26、I - 1 - a - 27、I - 1 - a - 28、I - 1 - a - 29、I - 1 - a - 31、I - 1 - a - 32、I - 1 - a - 33、I - 1 - a - 34、I - 1 - a - 35、I - 1 - a - 36、I - 1 - a - 37、I - 1 - a - 38、I - 1 - a - 39、I - 1 - a - 40、I - 1 - a - 41、I - 1 - a - 42、I - 1 - a - 43、I - 1 - a - 44、I - 1 - a - 45、I - 1 - a - 46、I - 1 - a - 47、I - 1 - a - 48、I - 1 - a - 49、I - 1 - a - 50、I - 1 - a - 51、I - 1 - a - 52、I
40
50

- 1 - a - 5 4、I - 1 - a - 5 5、I - 1 - a - 5 6、I - 1 - a - 5 7、I - 1 - a - 5 8、I - 1 - b - 1、I - 1 - b - 2、I - 1 - b - 3、I - 1 - b - 4、I - 1 - b - 5、I - 1 - b - 6、I - 1 - b - 7、I - 1 - c - 1、I - 1 - c - 2、I - 1 - c - 3、I - 1 - c - 4、I - 1 - c - 5、I - 1 - c - 6、I - 1 - c - 7、I - 1 - c - 8、I - 1 - c - 9、I - 1 - c - 1 0、I - 1 - c - 1 1、I - 1 - c - 1 2、I - 1 - c - 1 3、I - 1 - c - 1 4、I - 1 - c - 1 5、I - 1 - c - 1 6、I - 1 - c - 1 8、I - 1 - c - 2 1、I - 1 - b - 2、I - 2 - a - 1、I - 2 - a - 2、I - 2 - a - 3、I - 2 - a - 4、I - 2 - a - 5、I - 2 - a - 6、I - 2 - a - 7、I - 2 - a - 8、I - 2 - a - 1 0、I - 2 - a - 1 1、I - 2 - a - 1 2、I - 2 - a - 1 3、I - 2 - a - 1 4、I - 2 - a - 1 5、I - 2 - a - 1 6、I - 2 - a - 1 7、I - 2 - a - 1 8、I - 2 - a - 1 9、I - 2 - a - 2 0、I - 2 - a - 2 1、I - 2 - a - 2 2、I - 2 - a - 2 3、I - 2 - a - 2 4、I - 2 - a - 2 5、I - 2 - a - 2 6、I - 2 - a - 2 7、I - 2 - a - 2 8、I - 2 - a - 2 9、I - 2 - a - 3 0、I - 2 - a - 3 1、I - 2 - a - 3 2、I - 2 - a - 3 3、I - 2 - a - 3 4、I - 2 - a - 3 5、I - 2 - a - 3 6、I - 2 - a - 3 8、I - 2 - a - 3 9、I - 2 - a - 4 0、I - 2 - a - 4 1、I - 2 - a - 4 2、I - 2 - a - 4 3、I - 2 - a - 4 4、I - 2 - a - 4 5、I - 2 - a - 4 6、I - 2 - a - 4 7、I - 2 - a - 4 8、I - 2 - a - 4 9、I - 2 - a - 5 0、I - 2 - a - 5 1、I - 2 - b - 1、I - 2 - b - 2、I - 2 - b - 5、I - 2 - b - 6、I - 2 - b - 7、I - 2 - b - 8、I - 2 - b - 9、I - 2 - b - 1 0、I - 2 - b - 1 2、I - 2 - b - 1 3、I - 2 - b - 1 4、I - 2 - b - 1 5、I - 2 - b - 1 6、I - 2 - b - 1 7、I - 2 - b - 1 8、I - 2 - b - 1 9、I - 2 - b - 2 2、I - 2 - b - 2 3、I - 2 - b - 2 4、I - 2 - c - 1、I - 2 - c - 2、I - 2 - c - 3、I - 2 - c - 4。 10

【0484】実施例7ネコブセンチュウ (Meloidogyne) 試験 (MELGIN噴霧処理)

溶媒： 80重量部のアセトン

【0485】

活性化合物の適切な調製物を調製するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒と混合し、得られた濃厚物を水で稀釈して所望の濃度とする。 30

【0486】

容器に、砂、活性化合物の溶液、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*) の卵・幼虫の懸濁液及びレタス種子を入れる。レタス種子が発芽し、植物が生育する。根では、こぶが形成される。

【0487】

所望の期間が経過した後、殺線虫活性(%)をこぶの形成により求める。100%は、こぶが見られなかったことを意味し、0%は、処理された植物におけるこぶの数が未処理対照におけるこぶの数に相当することを意味する。

【0488】

この試験において、例えば、調製実施例の以下の化合物は、500g/h aの施用量で80%以上の効果を示す： 40

実施例番号 I - 2 - a - 4、I - 2 - a - 5、I - 2 - b - 9、I - 2 - a - 1 1。

【0489】実施例8オウシマダニ (Boophilus microplus) 試験 (BOPMI注入)

溶媒： ジメチルスルホキシド

【0490】

活性化合物の適切な調製物を調製するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒と混合し、得られた濃厚物を水で稀釈して所望の濃度とする。

【0491】

活性化合物の該溶液を腹部（オウシマダニ (*Boophilus microplus*)）に注入し、その動物を皿に移し、人工気象室（climatized room）内で維持する。その活性は、受精卵の産卵（deposition）について試験することによって確認する。

【0492】

所望の期間が経過した後、活性（%）を求める。この場合、100%は、受精卵を産卵したマダニが無かったことを意味する

この試験において、例えば、調製実施例の以下の化合物は、20 μg / 動物の施用量で80%以上の効力を示す：

実施例番号 I - 1 - a - 3、I - 1 - a - 4、I - 1 - a - 5、I - 1 - a - 6、I - 1 - b - 1、I - 2 - a - 1。

10

【0493】

実施例9

ヒツジキンバエ (*Lucilia cuprina*) 試験 (LUCICU)

溶媒：ジメチルスルホキシド

【0494】

活性化合物の適切な調製物を調製するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒と混合し、得られた濃厚物を水で稀釀して所望の濃度とする。

【0495】

所望の濃度を有する活性化合物調製物で処理した馬肉を含んでいる容器に、ヒツジキンバエ (*Lucilia cuprina*) の幼虫を入れる。

20

【0496】

所望の期間が経過した後、殺虫率（%）を求める。100%は、全ての幼虫が死んだことを意味し、0%は、死んだ幼虫が無かったことを意味する。

【0497】

この試験において、例えば、調製実施例の以下の化合物は、100 ppmの施用量で80%以上の効力を示す：

実施例番号 I - 1 - a - 3、I - 1 - a - 4、I - 1 - a - 5、I - 1 - a - 6、I - 1 - a - 7、I - 1 - a - 8、I - 1 - b - 1、I - 1 - c - 2、I - 1 - c - 3、I - 1 - c - 4、I - 2 - a - 1。

【0498】

30

実施例10

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) 試験 (MYZUPE)

溶媒：7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤：2重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

【0499】

活性化合物の適切な調製物を調製するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤を含有している水で稀釀して所望の濃度とする。アンモニウム塩、浸透剤又はアンモニウム塩と浸透剤の必要とされる施用のために、これらは、それぞれ、該調製物のそれぞれの完成した溶液を希釈した後、ピペットを用いて1000 ppmの濃度で添加する。

40

【0500】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が重度に寄生しているパプリカ (*Capsicum annuum*) 植物を、所望の濃度を有する活性化合物調製物を噴霧することにより処理する。

【0501】

所望の期間が経過した後、殺虫率（%）を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

【0502】

この試験において、例えば、調製実施例の以下の化合物は、良好な効力を示す：表を参照されたい。

50

【0503】

【表20】

RME 及び RME+AMS を添加することによる活性の増大		活性化合物	ppm	6日後の効力 (%)			+ RME + AMS
				添加剤無	+ AMS	+ RME	
実施例 (I-1-a-8)	MYZUPE	4 0.8	45 0	98 0	99 20	100 99	
実施例 (I-1-a-4)	MYZUPE	4 0.8	75 10	80 0	90 60	98 99	

【0504】

実施例 11

ワタアブラムシ (Aphis gossypii) 試験 (APHIGO)

溶媒 : 7 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤 : 2 重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

【0505】

活性化合物の適切な調製物を調製するために、1 重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤を含有している水で稀釈して所望の濃度とする。アンモニウム塩、浸透剤又はアンモニウム塩と浸透剤の必要とされる施用のために、これらは、それぞれ、該調製物のそれぞれの完成した溶液を希釈した後、ピペットを用いて 1000 ppm の濃度で添加する。

【0506】

ワタアブラムシ (Aphis gossypii) が重度に寄生しているワタ (*Gossypium hirsutum*) 植物の葉に、所望の濃度を有する活性化合物調製物を噴霧する。

【0507】

所望の期間が経過した後、殺虫率 (%) を求める。100% は、全てのアブラムシが死んだことを意味し、0% は、死んだアブラムシが無かったことを意味する。

【0508】

この試験において、例えば、調製実施例の以下の化合物は、良好な効力を示す：表を参照されたい。

【0509】

【表21】

RME 及び RME+AMS を添加することによる活性の増大		活性化合物	ppm	6日後の効力 (%)			+ RME + AMS
				添加剤無	+ AMS	+ RME	
実施例 (I-1-a-4)	APHIGO	4 0.8	60 10	75 0	75 15	80 45	
実施例 (I-1-a-6)	APHIGO	20	35	5	60	95	

RME = ナタネ油メチルエステル

AMS = 硫酸アンモニウム

10

20

30

40

50

【0510】

実施例12オオタバコガ (*Heliothis virescens*) 試験 - トランスジェニック植物の処理

溶媒 : 7重量部のアセトン

乳化剤 : 1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

【0511】

活性化合物の適切な調製物を調製するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び上記量の乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で稀釈して所望の濃度とする。

【0512】

所望の濃度を有する活性化合物調製物中に浸漬することにより、品種 R o u n d u p Ready (「Monsanto Comp. USA」の商標) のダイズ (*Glycine max*) の苗条を処理し、ダイズの葉がまだ湿っている間に、オオタバコガ (tobacco budworm) (*Heliothis virescens*) を寄生させる。 10

【0513】

所望の期間が経過した後、当該昆虫についての殺虫率を求める。

【0514】

実施例13限界濃度試験 / 土壌昆虫 - トランスジェニック植物の処理

被験昆虫 : ジアプロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*) - 土壌中の幼虫

溶媒 : 7重量部のアセトン

乳化剤 : 1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

20

【0515】

活性化合物の適切な調製物を調製するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒と混合し、上記量の乳化剤を添加し、得られた濃厚物を水で稀釈して所望の濃度とする。

【0516】

活性化合物の該調製物を土壌に注ぐ。ここで、該調製物中の活性化合物の濃度は実質的に重要ではなく、土壌の単位容積当たりの活性化合物の重量 (これは、ppm (mg/L)) で示される。のみが重要である。土壌を 0.25 L 容のポットに入れ、20 で静置する。

【0517】

30

準備した後、すぐに、各ポット内に、品種 Y I E L D G A R D (「Monsanto Comp., USA」の商標) の予め発芽させておいた 5 粒のトウモロコシを置く。2日後、適切な被験昆虫を処理された土壌中に配置する。さらに 7 日間経過した後、出芽したトウモロコシ植物の数を数えることにより、当該活性化合物の効力を求める (1 植物 = 20 % 活性)。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I
A 01N 43/08 (2006.01)	A 01N 43/08 H
A 01N 47/06 (2006.01)	A 01N 47/06 D
A 01N 25/32 (2006.01)	A 01N 25/32
A 01N 25/30 (2006.01)	A 01N 25/30
C 07D 493/10 (2006.01)	C 07D 493/10 F

- (72)発明者 ブレトシユナイダー , トーマス
ドイツ国、5 3 7 9 7 ・ローマル、タールシユトラーセ・2 9 ・ベー
- (72)発明者 フィツシヤー , ライナー
ドイツ国、4 0 7 8 9 ・モンハイム、ネリー - ザクス - シュトラーセ・2 3
- (72)発明者 ランゲ , グートルン
ドイツ国、5 6 7 7 9 ・ケルクハイム、アム・バルデツク・5 1
- (72)発明者 レーア , シュテファン
ドイツ国、6 5 8 3 5 ・リーダーバッハ、ズルツバッハ・シュトラーセ・1 1 5
- (72)発明者 アルノルト , クリストイアン
ドイツ国、4 0 7 6 4 ・ランゲンフェルト、パストア - レー - シュトラーセ・4 2
- (72)発明者 フォイヒト , デイーター
ドイツ国、6 5 7 6 0 ・エシュボーン、アム・ブルクグラーベン・7 ・アー
- (72)発明者 フランケン , エーフア - マリア
フランス国、エフ - 6 9 7 6 0 ・リモネスト、ルート・ドウ・ベルビュ・4 2 2
- (72)発明者 ヒルズ , マーテイン・ジエフリー
ドイツ国、6 5 5 1 0 ・イドシュタイン、アム・イツツエルグルント・5 ・ベー
- (72)発明者 ケーネ , ハインツ
ドイツ国、6 5 7 1 9 ・ホフハイム、イルティスペーク・7 ・アー
- (72)発明者 マルサム , オルガ
ドイツ国、5 1 5 0 3 ・レースラート、フォ・デム・クロスターホフ・1 9
- (72)発明者 ロジンガー , クリストファー・ヒュー
ドイツ国、6 5 7 1 9 ・ホフハイム、アム・ホツホフェルト・3 3
- (72)発明者 デイツゲン , ヤン
ドイツ国、6 0 3 1 6 ・フランクフルト、ブルクシュトラーセ・2 6
- (72)発明者 ゲーアゲンス , ウルリヒ
ドイツ国、4 0 8 8 2 ・ラティングン、フエスター・シュトラーセ・3 7
- (72)発明者 ホイザー - ハーン , イゾルデ
ドイツ国、5 1 3 7 5 ・レバークーゼン、デュンフェルダーシュトラーセ・2 2

審査官 伊藤 幸司

- (56)参考文献 特開平06-263731(JP, A)
国際公開第2006/089633(WO, A1)
特開2005-350456(JP, A)
特表2003-528097(JP, A)
米国特許出願公開第2004/0072802(US, A1)
米国特許第04525201(US, A)

- (58)調査した分野(Int.Cl. , DB名)

C 07D
A 01N

(156)

JP 5475660 B2 2014.4.16

CAPLUS/REGISTRY(STN)