

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号

特表2011-507893

(P2011-507893A)

(43) 公表日 平成23年3月10日 (2011.3.10)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 237/16 (2006.01)	C O 7 D 237/16 C S P	4 C O 6 3
C O 7 D 403/04 (2006.01)	C O 7 D 403/04	4 H O 1 1
C O 7 D 405/14 (2006.01)	C O 7 D 405/14	
C O 7 D 417/04 (2006.01)	C O 7 D 417/04	
C O 7 D 409/14 (2006.01)	C O 7 D 409/14	
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 190 頁) 最終頁に続く		

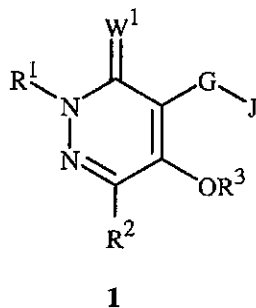
(21) 出願番号	特願2010-539847 (P2010-539847)	(71) 出願人	390023674
(86) (22) 出願日	平成20年12月19日 (2008.12.19)		イー・アイ・デュポン・ドウ・ヌムール・
(85) 翻訳文提出日	平成22年8月11日 (2010.8.11)		アンド・カンパニー
(86) 国際出願番号	PCT/US2008/087577		E. I. DU PONT DE NEMO
(87) 国際公開番号	W02009/086041		URS AND COMPANY
(87) 国際公開日	平成21年7月9日 (2009.7.9)		アメリカ合衆国、デラウェア州、ウイلم
(31) 優先権主張番号	61/008,861		ントン、マーケット・ストリート 100
(32) 優先日	平成19年12月21日 (2007.12.21)		7
(33) 優先権主張国	米国 (US)	(74) 代理人	100127926
			弁理士 結田 純次
		(74) 代理人	100140132
			弁理士 竹林 則幸
		(72) 発明者	トマス・マーティン・スティーヴンソン
			アメリカ合衆国デラウェア州19702.
			ニューアーク、イロクォイコート103
			最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 除草性ピリダジノン誘導体

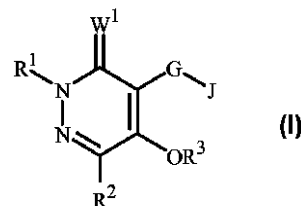
(57) 【要約】

式 1

【化 1】



1



(II)

(式中、W¹ は O または S であると共に、R¹、R²、R³、G および J は開示中に定義されているとおりである)

の化合物、その N - オキシドおよび塩が開示されている。

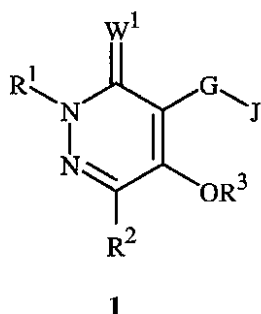
式 1 の化合物を含有する組成物、ならびに、望ましくない植生またはその環境に、有効量の本発明の化合物ま

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 1

【化 1】



10

[式中、

R¹ は、H、C₁ ~ C₆ アルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₂ ~ C₆ アルキニル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₂ ~ C₆ ハロアルケニル、C₂ ~ C₆ ハロアルキニル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₃ ~ C₈ ハロシクロアルキル、C₄ ~ C₁₀ アルキルシクロアルキル、C₄ ~ C₁₀ シクロアルキルアルキル、C₆ ~ C₁₄ シクロアルキルシクロアルキル、C₄ ~ C₁₀ ハロシクロアルキルアルキル、C₅ ~ C₁₂ アルキルシクロアルキルアルキル、C₃ ~ C₈ シクロアルケニル、C₃ ~ C₈ ハロシクロアルケニル、C₂ ~ C₈ アルコキシアルキル、C₄ ~ C₁₀ シクロアルコキシアルキル、C₃ ~ C₁₀ アルコキシアルコキシアルキル、C₂ ~ C₈ アルキルチオアルキル、C₂ ~ C₈ アルキルスルフィニルアルキル、C₂ ~ C₈ アルキルスルホニルアルキル、テトラヒドロピラニル、-C(=W⁶)R⁴、-C(=W²)W³R⁵、-S(=O)₂R⁶、-P(=W⁴)R⁷R⁸または -C(=W⁵)NR⁹R¹⁰であり；

20

R² は、H、ハロゲン、シアノ、-C(=O)OH、-C(=O)NH₂、C₁ ~ C₆ アルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₂ ~ C₆ アルキニル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₂ ~ C₆ ハロアルケニル、C₂ ~ C₆ ハロアルキニル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₃ ~ C₈ ハロシクロアルキル、C₄ ~ C₁₀ アルキルシクロアルキル、C₄ ~ C₁₀ シクロアルキルアルキル、C₆ ~ C₁₄ シクロアルキルシクロアルキル、C₄ ~ C₁₀ ハロシクロアルキルアルキル、C₅ ~ C₁₂ アルキルシクロアルキルアルキル、C₃ ~ C₈ シクロアルケニル、C₃ ~ C₈ ハロシクロアルケニル、C₂ ~ C₈ アルコキシアルキル、C₄ ~ C₁₀ シクロアルコキシアルキル、C₃ ~ C₁₀ アルコキシアルコキシアルキル、C₂ ~ C₈ アルキルチオアルキル、C₂ ~ C₈ アルキルスルフィニルアルキル、C₂ ~ C₈ アルキルスルホニルアルキル、C₂ ~ C₈ アルコキシカルボニル、C₄ ~ C₁₀ シクロアルコキシカルボニル、C₅ ~ C₁₂ シクロアルキルアルコキシカルボニル、C₂ ~ C₈ アルキルアミノカルボニル、C₃ ~ C₁₀ ジアルキルアミノカルボニル、C₄ ~ C₁₀ シクロアルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルコキシ、C₁ ~ C₆ ハロアルコキシ、C₁ ~ C₆ アルキルチオ、C₁ ~ C₆ ハロアルキルチオ、ニトロ、C₃ ~ C₆ シクロアルコキシまたは C₄ ~ C₈ シクロアルキルアルコキシであり；

30

R³ は、H、-C(=W⁶)R⁴、-C(=W²)W³R⁵、-S(=O)₂R⁶、-P(=W⁴)R⁷R⁸または -C(=W⁵)NR⁹R¹⁰であり；

G は、フェニル環または 5 員もしくは 6 員芳香族複素環であって、各環は、窒素環員上の R^x で任意に置換され、そして炭素環員上の R^w から選択される 4 個以下の置換基で任意に置換され；

J は、フェニル環または 5 員もしくは 6 員芳香族複素環であって、各環は、R^u から独立して選択される最大 5 個の置換基で任意に置換され；

各 R⁴ は、独立して、C₁ ~ C₆ アルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₂ ~ C₆ アルキニル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₂ ~ C₆ ハロアルケニル、C₂ ~ C₆ ハロアルキニル

40

50

10

20

30

40

50

各 R¹⁰ は、独立して、H、C₁ ~ C₆ アルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₂ ~ C₆ アルキニル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₂ ~ C₆ ハロアルケニル、C₂ ~ C₆ ハロアルキニル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₃ ~ C₈ ハロシクロアルキル、C₄ ~ C₁₀ アルキルシクロアルキルまたは C₄ ~ C₁₀ シクロアルキルアルキルであるか；または

R^9 および R^{10} は、これらが結合している窒素と一緒にあって、連結窒素に加えて、炭素、および任意に O、S および NR^{13} から選択される環員を含有する 3 員 ~ 7 員複素環を形成し、炭素環員は、任意に $C(=O)$ の形態にあり、そして環は、炭素環員上で、ハロゲン、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルキルおよび $C_1 \sim C_3$ アルコキシからなる群から独立して選択される最大 4 個の置換基で任意に置換され；

各 R^{11} および R^{12} は、独立して、H または $C_1 \sim C_3$ アルキルであり；

各 R^{13} は、独立して、H または $C_1 \sim C_3$ アルキルであり；

各 G^A は、独立して、フェニル環または 5 員もしくは 6 員芳香族複素環であって、各環は、 R^U から独立して選択される最大 5 個の置換基で任意に置換され；または R^U から独立して選択される最大 5 個の置換基で任意に置換されるナフタレニル環系であり；

各 R^U は、独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 SF_5 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニル、 $C_3 \sim C_{10}$ トリアルキルシリル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルアミノ、フェニル、ピリジニルまたはチエニルであり；

各 R^W は、独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 SF_5 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニル、 $C_3 \sim C_{10}$ トリアルキルシリル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルアミノ、ナフタレニル、 $-O(CR^{11}R^{12})_nG^A$ または $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ であり；

各 R^X は、独立して、H、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであり；

各 W^1 、 W^2 、 W^3 、 W^4 、 W^5 および W^6 は、独立して、O または S であり；そして

各 n は、独立して、0 ~ 3 から選択される整数である]、

その N - オキシドおよび塩から選択される化合物。

【請求項 2】

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、C

10

20

30

40

50

$C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_6 \sim C_{14}$ シクロアルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキルまたは $C_3 \sim C_{10}$ アルコキシアルコキシアルキルであり；

R^2 は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキルまたは $C_1 \sim C_4$ アルコキシであり；

R^3 は、H、 $-C(=W^6)R^4$ 、 $-C(=W^2)W^3R^5$ 、 $-S(=O)_2R^6$ または $-C(=W^5)NR^9R^{10}$ であり；

G は、フェニル環または 5 員もしくは 6 員芳香族複素環であって、各環は、窒素環員上の R^x で任意に置換され、そして炭素環員上の R^w から選択される最大 2 個の置換基で任意に置換され；

各 R^w は、独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 SF_5 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $-O(CR^{11}R^{12})_nG^A$ または $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ であり；

各 R^x は、独立して、H または $C_1 \sim C_3$ アルキルであり；

J は、フェニルまたは 5 員もしくは 6 員芳香族複素環であって、各環は、 R^u から独立して選択される最大 3 個の置換基で置換され；そして

各 R^u は、独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 SF_5 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルアミノ、フェニル、ピリジニルまたはチエニルである；請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルまたは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルであり；

R^2 は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ アルコキシであり；

G は、

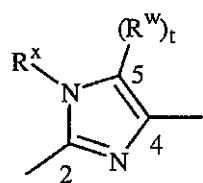
10

20

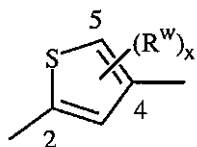
30

40

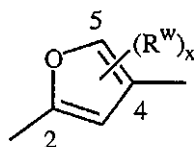
【化 2】



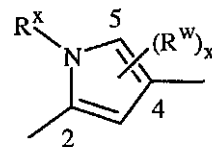
G-3



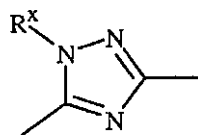
G-4



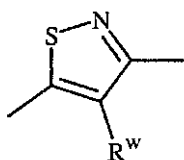
G-5



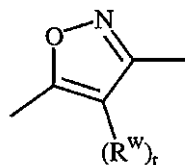
G-6



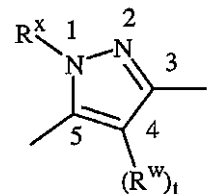
G-9



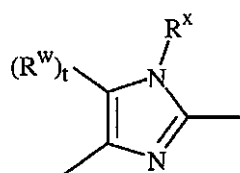
G-10



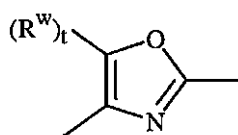
G-11



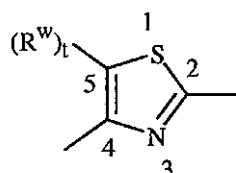
G-12



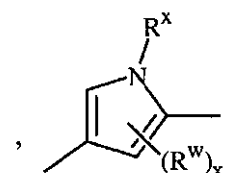
G-13



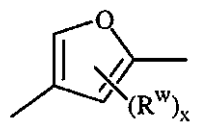
G-14



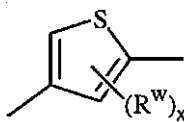
G-15



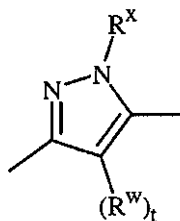
G-16



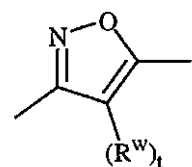
G-17



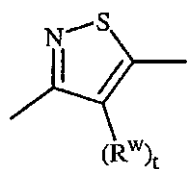
G-18



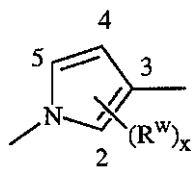
G-22



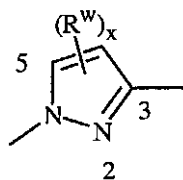
G-23



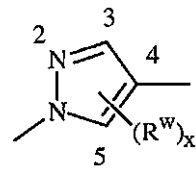
G-24



G-25



G-26



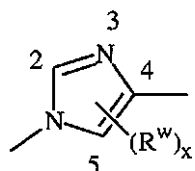
G-27

10

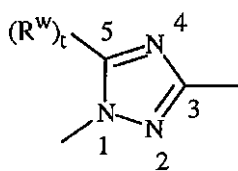
20

30

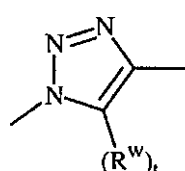
【化 3】



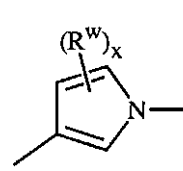
G-28



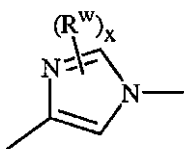
G-29



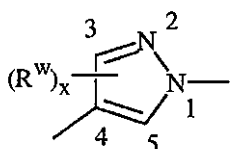
G-30



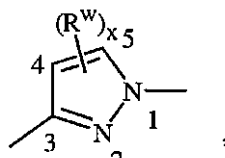
G-31



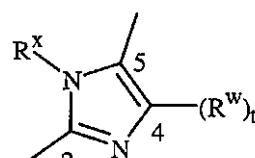
G-33



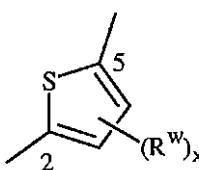
G-34



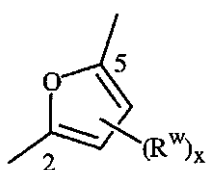
G-35



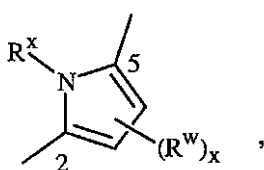
G-39



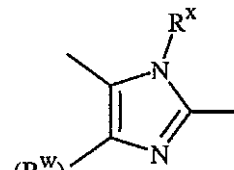
G-40



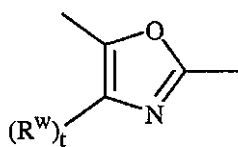
G-41



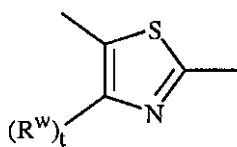
G-42



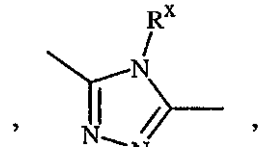
G-43



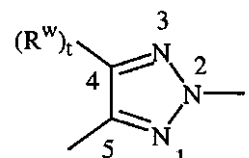
G-44



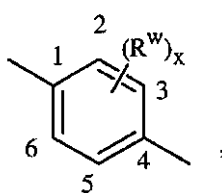
G-45



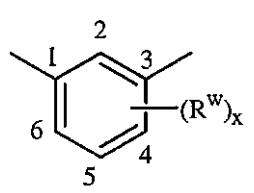
G-48



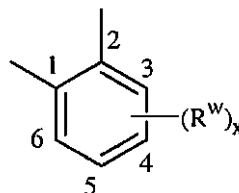
G-50



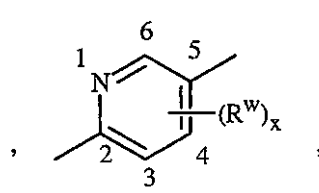
G-53



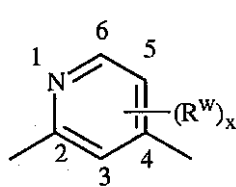
G-54



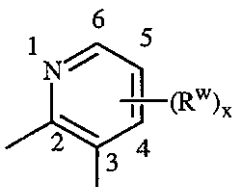
G-55



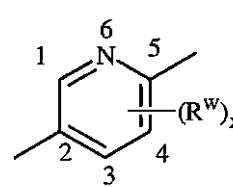
G-56



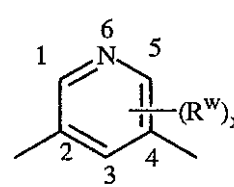
G-57



G-58



G-59



G-60

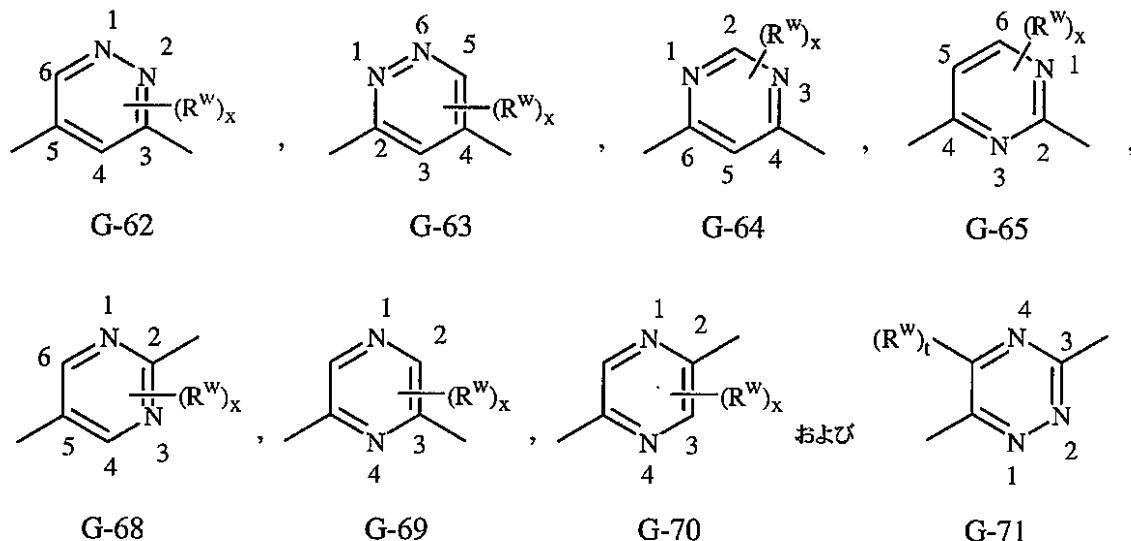
10

20

30

40

【化 4】



10

20

30

40

50

[式中、左側に突出している結合は式 1 のピリダジノン環に結合し、右側に突出している結合は J に結合し；そして x は、0 ~ 2 から選択される整数であり；

各 R^w は、独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-O(CR^{11}R^{12})_nG^A$ または $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ であり；

J は、 R^u から独立して選択される最大 3 個の置換基で任意に置換されるフェニル環であり；

各 R^u は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノまたはフェニルであり；そして

W^1 は O である]

請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 は、H または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

R^2 は、H、Cl、 CH_3 、Et または OMe であり；

R^3 は、H、 CO_2-i-Pr または $CO-t-Bu$ であり；

G は、G - 12 ~ G - 15、G - 26 ~ G - 29、G - 34、G - 35、G - 54 および G - 65 から選択され；

各 R^w は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $-O(CR^{11}R^{12})_nG^A$ であり；

J は、 R^u から選択される置換基で置換されているフェニルであり；そして

各 R^u は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルである、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

R^1 は CH_3 であり；

R^2 は H であり；

G は、G - 12、G - 15、G - 26、G - 28、G - 29、G - 34、G - 35、G - 54 および G - 65 から選択され；

各 R^w は、独立して CH_3 または Et であり；

J は、パラ位で、 R^u から選択される置換基で置換されているフェニルであり；そして各 R^u は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルである、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

G は G - 26 であり ;

x は 1 であり ;

R^w は G - 26 の 5 位に位置し ; そして

各 R^u は、独立して、C1、Br または CF₃ である、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 4 - [5 - メチル - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 3 (2H) - ピリダジノン、

4 - [3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1H - ピラゾール - 3 - イル] - 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 (2H) - ピリダジノン、

5 - [3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 , 6 - ジヒドロ - 1 - メチル - 6 - オキソ - 4 - ピリダジニル - 1 - メチルエチル カーボネート、

4 - [3 - (4 - ブロモフェニル) - 5 - メチル - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 5 - ヒドロキシ - 3 (2H) - ピリダジノン、

4 - [5 - エチル - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 (2H) - ピリダジノン、および

4 - [3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - エチル - 4 - メチル - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 (2H) - ピリダジノン

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

除草的に有効な量の請求項 1 に記載の化合物、ならびに界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 つの構成成分を含む除草組成物。

【請求項 9】

除草的に有効な量の請求項 1 に記載の化合物、他の除草剤および薬害軽減剤からなる群から選択される有効量の少なくとも 1 つの追加の有効成分、ならびに界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 つの成分を含む除草組成物。

【請求項 10】

植生またはその環境に、除草的に有効な量の請求項 1 に記載の化合物を接触させる工程を含む望ましくない植生の成長を防除する方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、一定のピリダジノン誘導体、その N - オキシド、塩および組成物、ならびに、望ましくない植生を防除するためのその使用方法に関する。

【背景技術】

【0002】

望ましくない植生の防除は、高い作物効率を達成するためにきわめて重要である。特に、とりわけ、イネ、ダイズ、サトウダイコン、トウモロコシ、ジャガイモ、コムギ、オオムギ、トマトおよびプランテーション作物などの有用な作物における雑草の生長の選択的な防除の達成がきわめて望ましい。このような有用な作物における野放しの雑草の生長は生産性の顕著な低減を引き起こし、これにより、消費者に対する費用の増加をもたらされる可能性がある。非作物領域における望ましくない植生の防除もまた重要である。多くの製品がこれらの目的のために市販されているが、より効果的、より安価で、より毒性が低く、環境的に安全または異なる作用部位を有する新規の化合物に対する要求が未だある。

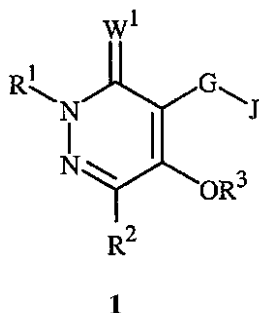
【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0003】

本発明は、式 1 :

【化 1】



10

[式中、

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_6 \sim C_{14}$ シクロアルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、テトラヒドロピラニル、 $-C(=W^6)R^4$ 、 $-C(=W^2)W^3R^5$ 、 $-S(=O)_2R^6$ 、 $-P(=W^4)R^7R^8$ または $-C(=W^5)NR^9R^{10}$;

20

R^2 は、H、ハロゲン、シアノ、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_6 \sim C_{14}$ シクロアルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、ニトロ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルコキシまたは $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルコキシであり ;

30

【0004】

R^3 は、H、 $-C(=W^6)R^4$ 、 $-C(=W^2)W^3R^5$ 、 $-S(=O)_2R^6$ 、 $-P(=W^4)R^7R^8$ または $-C(=W^5)NR^9R^{10}$ であり ;

40

G は、フェニル環または 5 員もしくは 6 員芳香族複素環であって、各環は、窒素環員上の R^x で任意により置換されていると共に、炭素環員上の R^w から選択される 4 個以下の置換基で任意により置換されており ;

J は、フェニル環または 5 員もしくは 6 員芳香族複素環であって、各環は、 R^u から独立して選択される 5 個以下の置換基で任意により置換されており ;

各 R^4 は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$

50

$C_1 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルアミノアルキルあるいは $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノアルキル、ナフタレニルまたは $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ であり；

各 R^5 は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルアミノアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノアルキル、ナフタレニルまたは $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ であり；

各 R^6 は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルアミノアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ハロジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルアミノ、ナフタレニルまたは $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ であり；

【0005】

各 R^7 および R^8 は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ハロジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルアミノ、ナフタレニルまたは $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ であり；

各 R^9 は、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノアルキル、ナフタレニルまたは $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ であり；

各 R^{10} は、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキルあるいは $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキルであるか；または

R^9 および R^{10} は、これらが結合している窒素と一緒に、結合窒素に追加して、炭素、ならびに、任意によりO、Sおよび NR^{13} から選択される環員を含有する3員

10

20

30

40

50

～ 7 員複素環を形成し、炭素環員は、任意により C (= O) の形態であると共に、環は、炭素環員上で、ハロゲン、 - C N、 C ₁ ～ C ₃ アルキルおよび C ₁ ～ C ₃ アルコキシからなる群から独立して選択される 4 個以下の置換基で任意により置換されており；

各 R ^{1 1} および R ^{1 2} は、独立して、H または C ₁ ～ C ₃ アルキルであり；

各 R ^{1 3} は、独立して、H または C ₁ ～ C ₃ アルキルであり；

各 G ^A は、独立して、フェニル環または 5 員もしくは 6 員芳香族複素環であって、各環は、R ^u から独立して選択される 5 個以下の置換基で任意により置換されており；または、R ^u から独立して選択される 5 個以下の置換基で任意により置換されているナフタレニル環系であり；

【 0 0 0 6 】

各 R ^u は、独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 - C H O、 - C (= O) O H、 - C (= O) N H ₂、 - S O ₂ N H ₂、S F ₅、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、C ₁ ～ C ₆ ハロアルキル、C ₃ ～ C ₈ シクロアルキル、C ₃ ～ C ₈ ハロシクロアルキル、C ₄ ～ C ₁₀ アルキルシクロアルキル、C ₄ ～ C ₁₀ シクロアルキルアルキル、C ₄ ～ C ₁₀ ハロシクロアルキルアルキル、C ₅ ～ C ₁₂ アルキルシクロアルキルアルキル、C ₂ ～ C ₈ アルキルカルボニル、C ₂ ～ C ₈ ハロアルキルカルボニル、C ₂ ～ C ₈ アルコキシカルボニル、C ₄ ～ C ₁₀ シクロアルコキシカルボニル、C ₅ ～ C ₁₂ シクロアルキルアルコキシカルボニル、C ₂ ～ C ₈ アルキルアミノカルボニル、C ₃ ～ C ₁₀ ジアルキルアミノカルボニル、C ₁ ～ C ₆ アルコキシ、C ₁ ～ C ₆ ハロアルコキシ、C ₂ ～ C ₈ アルキルカルボニルオキシ、C ₁ ～ C ₆ アルキルチオ、C ₁ ～ C ₆ ハロアルキルチオ、C ₁ ～ C ₆ アルキルスルフィニル、C ₁ ～ C ₆ ハロ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 ハロアルキルスルホニル、C ₁ ～ C ₆ アルキルアミノスルホニル、C ₂ ～ C ₈ ジアルキルアミノスルホニル、C ₃ ～ C ₁₀ トリアルキルシリル、C ₁ ～ C ₆ アルキルアミノ、C ₂ ～ C ₈ ジアルキルアミノ、C ₂ ～ C ₈ アルキルカルボニルアミノ、C ₁ ～ C ₆ アルキルスルホニルアミノ、フェニル、ピリジニルまたはチエニルであり；

各 R ^w は、独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 - C H O、 - C (= O) O H、 - C (= O) N H ₂、 - S O ₂ N H ₂、S F ₅、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、C ₁ ～ C ₆ ハロアルキル、C ₃ ～ C ₈ シクロアルキル、C ₃ ～ C ₈ ハロシクロアルキル、C ₄ ～ C ₁₀ アルキルシクロアルキル、C ₄ ～ C ₁₀ シクロアルキルアルキル、C ₄ ～ C ₁₀ ハロシクロアルキルアルキル、C ₅ ～ C ₁₂ アルキルシクロアルキルアルキル、C ₂ ～ C ₈ アルキルカルボニル、C ₂ ～ C ₈ ハロアルキルカルボニル、C ₂ ～ C ₈ アルコキシカルボニル、C ₄ ～ C ₁₀ シクロアルコキシカルボニル、C ₅ ～ C ₁₂ シクロアルキルアルコキシカルボニル、C ₂ ～ C ₈ アルキルアミノカルボニル、C ₃ ～ C ₁₀ ジアルキルアミノカルボニル、C ₁ ～ C ₆ アルコキシ、C ₁ ～ C ₆ ハロアルコキシ、C ₂ ～ C ₈ アルキルカルボニルオキシ、C ₁ ～ C ₆ アルキルチオ、C ₁ ～ C ₆ ハロアルキルチオ、C ₁ ～ C ₆ アルキルスルフィニル、C ₁ ～ C ₆ ハロ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 ハロアルキルスルホニル、C ₁ ～ C ₆ アルキルアミノスルホニル、C ₂ ～ C ₈ ジアルキルアミノスルホニル、C ₃ ～ C ₁₀ トリアルキルシリル、C ₁ ～ C ₆ アルキルアミノ、C ₂ ～ C ₈ ジアルキルアミノ、C ₂ ～ C ₈ アルキルカルボニルアミノ、C ₁ ～ C ₆ アルキルスルホニルアミノ、ナフタレニル、 - O (C R ^{1 1} R ^{1 2}) _n G ^A または - (C R ^{1 1} R ^{1 2}) _n G ^A であり；

各 R ^x は、独立して、H、C ₁ ～ C ₃ アルキルまたは C ₃ ～ C ₇ シクロアルキルであり；

各 W ¹、W ²、W ³、W ⁴、W ⁵ および W ⁶ は、独立して、O または S であり；ならびに

各 n は、独立して、0 ～ 3 から選択される整数である]

の化合物 (すべての幾何異性体および立体異性体を含む)、その N - オキシドおよび塩、これらを含む農学的組成物、ならびに、除草剤としてのこれらの使用に関する。

【0007】

より具体的には、本発明は、式1の化合物（すべての幾何異性体および立体異性体を含む）、そのN-オキシドまたは塩に関する。本発明はまた、除草的に有効な量の式1の化合物と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の構成成分とを含む除草組成物に関する。本発明は、植生またはその環境に、除草的に有効な量の式1の化合物（例えば、本明細書に記載の組成物として）を接触させる工程を含む、望ましくない植生の生長を防除する方法にさらに関する。

【発明を実施するための形態】

【0008】

本明細書において用いられるところ、「を含む (comprises)」、「を含む (comprising)」、「を含む (includes)」、「を含む (including)」、「を有する (has)」、「を有する (having)」、「を含有する (contains)」または「を含有する (containing)」という用語またはその他の変形のいずれかは、非排他的な包含をカバーすることを意図する。例えば、一連の構成要素を含む組成物、混合物、プロセス、方法、物品、または装置は、これらの構成要素のみに必ずしも制限されないが、明記されていない、またはこのような組成物、プロセス、方法、物品、または装置に固有の他の構成要素を包含してもよい。さらに、そうでないと明示的に記載されていない限りにおいて、「または」は、排他的なまたはではなく包含的なまたはを指す。例えば、条件AまたはBは以下のいずれか一方により充足される：Aが真であり（または存在する）およびBが偽である（または存在しない）、Aが偽であり（または存在しない）およびBが真である（または存在する）、およびAおよびBの両方が真である（または存在する）。

【0009】

また、本発明の構成要素または構成成分に先行する不定冠詞「a」および「an」は、構成要素または構成成分の例（すなわち出現）の数に関して非制限的であることが意図される。従って「a」または「an」は、1つ、または少なくとも1つを包含すると読解されるべきであり、および構成要素または構成成分の単数形の語はまた、その数が明らかに単数であることを意味する場合を除き複数形を包含する。

【0010】

本明細書において参照されるところ、単独で、または、「広葉雑草」などの語において用いられる「広葉」という用語は、2枚の子葉を有する胚芽によって特徴付けられる被子植物の群を説明するために用いられる用語である、双子葉植物 (dicot) または双子葉植物 (dicotyledon) を意味する。

【0011】

上記において、「アルキル」という用語は、「アルキルチオ」または「ハロアルキル」などの単独でまたは複合語のいずれかで用いられ、メチル、エチル、N-プロピル、i-プロピル、または異なるブチル、ペンチルまたはヘキシル異性体などの直鎖または分岐アルキルが挙げられる。「アルケニル」としては、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、および異なるブテニル、ペンテニルおよびヘキセニル異性体などの直鎖または分岐アルケンが挙げられる。「アルケニル」としてはまた、1, 2-プロパジエニルおよび2, 4-ヘキサジエニルなどのポリエンが挙げられる。「アルキニル」としては、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニルおよび異なるブチニル、ペンチニルおよびヘキシニル異性体などの直鎖または分岐アルキンが挙げられる。「アルキニル」としてはまた、2, 5-ヘキサジイニル (hexadiynyl) などの複数の三重結合から構成される部分を挙げることが可能である。

【0012】

「アルコキシ」としては、例えば、メトキシ、エトキシ、n-プロピルオキシ、イソプロピルオキシおよび異なるブトキシ、ペントキシおよびヘキシルオキシ異性体が挙げられる。「アルコキシアルキル」は、アルキル上でのアルコキシ置換を表す。「アルコキシアルキル」の例としては、 CH_3OCH_2 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$

、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ が挙げられる。「アルコキシアルコキシ」は、アルコキシ上でのアルコキシ置換を表す。「アルコキシアルコキシアルキル」は、アルコキシアルキル部分の直鎖または分岐アルコキシ部分に結合された少なくとも1種の直鎖または分岐アルコキシ部分を表す。「アルコキシアルコキシアルキル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_3)\text{CHOCH}_2-$ および $(\text{CH}_3\text{O})_2\text{CHOCH}_2-$ が挙げられる。「アルキルチオ」としては、メチルチオ、エチルチオ、および異なるプロピルチオ、ブチルチオ、ペンチルチオおよびヘキシルチオ異性体などの分岐または直鎖アルキルチオ部分が挙げられる。「アルキルスルフィニル」としては、アルキルスルフィニル基の両方のエナンチオマーが挙げられる。「アルキルスルフィニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})-$ および異なるブチルスルフィニル、ペンチルスルフィニルおよびヘキシルスルフィニル異性体が挙げられる。「アルキルスルホニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2-$ 、および異なるブチルスルホニル、ペンチルスルホニルおよびヘキシルスルホニル異性体が挙げられる。「アルキルチオアルキル」は、アルキル上でのアルキルチオ置換を表す。「アルキルチオアルキル」の例としては、 CH_3SCH_2 、 $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ が挙げられる。「アルキルアミノ」、「ジアルキルアミノ」等は、上記の例と同様に定義される。

10

20

【0013】

「シクロアルキル」としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルが挙げられる。「アルキルシクロアルキル」という用語は、シクロアルキル部分上でのアルキル置換を表し、例えば、エチルシクロプロピル、*i*-プロピルシクロブチル、3-メチルシクロペンチルおよび4-メチルシクロヘキシルが挙げられる。「シクロアルキルアルキル」という用語は、アルキル部分上でのシクロアルキル置換を表す。「シクロアルキルアルキル」の例としては、シクロプロピルメチル、シクロペンチルエチル、および直鎖または分岐アルキル基に結合した他のシクロアルキル部分が挙げられる。「シクロアルキルシクロアルキル」という用語は、他のシクロアルキル基で置換されているシクロアルキル基を表す。「シクロアルキルシクロアルキル」の例としては、2-シクロプロピルシクロプロピルおよび3-シクロプロピルシクロペンチルが挙げられる。「ハロシクロアルキルアルキル」という用語は、シクロアルキルアルキル部分のシクロアルキル部分、アルキル部分または両方上でのハロゲン置換を表す。「ハロシクロアルキルアルキル」の例としては、2-クロロシクロプロピルメチル、シクロペンチル-1-クロロエチル、および3-クロロシクロペンチル-1-クロロエチルが挙げられる。「シクロアルコキシ」という用語は、シクロペンチルオキシおよびシクロヘキシルオキシなどの酸素原子を介して結合されたシクロアルキルを表す。「シクロアルキルアルコキシ」は、アルキル鎖に結合している酸素原子を介して結合されたシクロアルキルアルキルを表す。「シクロアルキルアルコキシ」の例としては、シクロプロピルメトキシ、シクロペンチルエトキシ、および直鎖または分岐アルコキシ基に結合された他のシクロアルキル部分が挙げられる。「シクロアルケニル」としては、1,3-および1,4-シクロヘキサジエニルなどの2つ以上の二重結合を有する基、ならびに、シクロペンテニルおよびシクロヘキセニルなどの基が挙げられる。

30

40

【0014】

「テトラヒドロピラン」という用語は、5個の炭素原子と1個の酸素原子から構成される環員を有する6員環を表す。式1の化合物の残りへのテトラヒドロピラン環の結合点は、5個の炭素原子のいずれか1つである。「チエン」という用語は、1個の硫黄原子と4個の炭素原子とを含有する5員芳香族環を指す。

【0015】

「ハロゲン」という用語は、単独または「ハロアルキル」などの複合語の一方で、または「ハロゲンで置換されたアルキル」などの記載で用いられるとき、フッ素、塩素、臭素

50

またはヨウ素を含む。さらに、「ハロアルキル」などの複合語で用いられるとき、または「ハロゲンで置換されたアルキル」などの記載で用いられるとき、前記アルキルは、同一であっても異なってもよいハロゲン原子で部分的にまたは完全に置換されていてもよい。「ハロアルキル」または「ハロゲンで置換されたアルキル」の例としては、 F_3C- 、 $ClCH_2-$ 、 CF_3CH_2- および CF_3CCl_2- が挙げられる。「ハロシクロアルキル」、「ハロアルコキシ」、「ハロアルキルチオ」「ハロアルケニル」「ハロアルキニル」等という用語は、用語「ハロアルキル」と同様に定義される。「ハロアルコキシ」の例としては、 CF_3O- 、 CCl_3CH_2O- 、 $HCF_2CH_2CH_2O-$ および CF_3CH_2O- が挙げられる。「ハロアルキルチオ」の例としては、 CCl_3S- 、 CF_3S- 、 CCl_3CH_2S- および $ClCH_2CH_2CH_2S-$ が挙げられる。「ハロアルキルスルフィニル」の例としては、 $CF_3S(O)-$ 、 $CCl_3S(O)-$ 、 $CF_3CH_2S(O)-$ および $CF_3CF_2S(O)-$ が挙げられる。「ハロアルキルスルホニル」の例としては、 $CF_3S(O)_2-$ 、 $CCl_3S(O)_2-$ 、 $CF_3CH_2S(O)_2-$ および $CF_3CF_2S(O)_2-$ が挙げられる。「ハロアルケニル」の例としては、 $(Cl)_2C=CHCH_2-$ および $CF_3CH_2CH=CHCH_2-$ が挙げられる。「ハロアルキニル」の例としては、 $HC-CCHCl-$ 、 CF_3C-C- 、 CCl_3C-C- および FCH_2C-CCH_2- が挙げられる。「ハロアルコキシアルコキシ」の例としては、 CF_3OCH_2O- 、 $ClCH_2CH_2OCH_2CH_2O-$ 、 $Cl_3CCH_2OCH_2O-$ 、ならびに、分岐アルキル誘導体が挙げられる。「ハロアルキルアミノアルキル」は、アルキルアミノアルキル基で置換されたハロゲン基を表す。「ハロアルキルアミノアルキル」としては、いずれかのアルキル基、ならびに、窒素に結合したハロゲン基が挙げられる。「ハロアルキルアミノアルキル」の例としては、 CH_3NHCH_2CHCl- 、 $(CH_3)CHClCH(CH_3)NHCH_2-$ および $CH_3NCCH(CH_3)-$ が挙げられる。「ハロジアルキルアミノ」という用語は、ジアルキルアミノ基のいずれかのアルキル部分で置換された少なくとも1個のハロゲン基を表す。「ハロジアルキルアミノ」の例としては、 $CF_3(CH_3)N-$ 、 $(CF_3)_2N-$ および $CH_2Cl(CH_3)N-$ が挙げられる。「シクロアルキルアミノ」とは、アミノ窒素原子が、シクロアルキルラジカルおよび水素原子に結合していることを意味し、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およびシクロヘキシルアミノなどの基が挙げられる。

10

20

30

40

【0016】

「アルキルカルボニル」は、 $C(=O)$ 部分に結合した直鎖または分岐アルキル部分を表す。「アルキルカルボニル」の例としては、 $CH_3C(=O)-$ 、 $CH_3CH_2CH_2C(=O)-$ および $(CH_3)_2CHC(=O)-$ が挙げられる。「アルコキシカルボニル」の例としては、 $CH_3OC(=O)-$ 、 $CH_3CH_2OC(=O)-$ 、 $CH_3CH_2CH_2OC(=O)-$ 、 $(CH_3)_2CHOC(=O)-$ および異なるブトキシ-またはペンタオキシカルボニル異性体が挙げられる。「シクロアルキルアルコキシカルボニル」という用語は、オキシカルボニル部分の酸素原子に結合されたシクロアルキルアルキル部分を表す。「シクロアルキルアルコキシカルボニル」の例としては、シクロプロピル- $CH_2OC(=O)-$ 、シクロプロピル- $CH(CH_3)OC(=O)-$ およびシクロペンチル- $CH_2OC(=O)-$ が挙げられる。

【0017】

置換基中の炭素原子の総数が接頭語「 $C_i \sim C_j$ 」により示されており、ここで、 i および j は1～14の数である。例えば、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルはメチルスルホニルからブチルスルホニルを指し； C_2 アルコキシアルキルは CH_3OCH_2 を指し； C_3 アルコキシアルキルは、例えば、 $CH_3CH(OCH_3)$ 、 $CH_3OCH_2CH_2$ または $CH_3CH_2OCH_2$ を指し；および C_4 アルコキシアルキルは、合計で4個の炭素原子を含有するアルコキシ基でされた置換アルキル基の種々の異性体を指し、例としては、 $CH_3CH_2CH_2OCH_2$ および $CH_3CH_2OCH_2CH_2$ が挙げられる。

【0018】

「任意により置換されている」という用語は、未置換であるか、または、置換されてい

50

ることを意味する。従って、任意により置換されている基（すなわちラジカル）は、未置換であるか、または、少なくとも１個の非水素置換基を有する。任意により置換されている基が任意の置換基を特定することなく定義されている場合、この基は、未置換であるか、または、未置換の類似体が有する生物学的活性を消失させない少なくとも１個の非水素置換基である。可能な置換基の列挙が特定されている場合、任意の置換基は、独立して、この列挙から選択される。特定の限定が言及されていない限りにおいて、基は、基におけるいずれかの利用可能な炭素または窒素原子上の非水素置換基で水素原子を置き換えることにより受け入れられることが可能である限り多くの任意の置換基で置換されることが可能である。しかも、各置換は、他とは独立している。「任意により置換されている」という用語に「 J 」について列挙されている基などの限定が伴っている場合、置換のためのさらなる位置が利用可能であるとしても、任意の置換基の数は、この限定を超えることはできない。従って、例えば、「５個以下の置換基で任意により置換されている」という句は、置換のために利用可能な位置の数が伴う場合、置換基が不在であり得ること、１個の置換基が存在し得ること、または５個以下の置換基が存在し得ることを意味する。

10

20

30

40

50

【００１９】

下付文字が、例えば $(R)_{i \sim j}$ といった範囲を示す場合には、置換基の数は、 i 以上 j 以下の間の整数から選択され得る。例えば R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} または R^{13} といった、基が水素であることが可能である置換基を含有する場合に、この置換基が水素とされる場合には、これは、前記基は未置換であることと等しいと認識される。例えば $(CR^{11}R^{12})_n$ （式中、 n は 0 であり得る）のように、連接基が任意により存在すると示される場合、この連接基は直接的な結合であってもよい（すなわち、 n が 0 である場合）。基上の 1 つ以上の位置が「置換されていない」か、または、「未置換である」と言われる場合には、有効原子価のいずれかを埋めるために水素原子が結合されている。

【００２０】

「芳香族」は、環原子の各々が基本的に同一の平面内にあると共に環平面に垂直な p -軌道を有すること、および、 $(4n+2)$ 電子（ n は正の整数である）が環に関連してヒュッケルの法則に従っていることを示す。完全不飽和炭素環がヒュッケルの法則を満たす場合、前記環はまた「芳香族環」とも呼ばれる。完全不飽和複素環がヒュッケルの法則を満たす場合、前記環はまた「芳香族複素環」とも呼ばれる。他に示されていない限りにおいて、複素環は、いずれかの利用可能な炭素または窒素を介して、前記炭素または窒素上の水素を置き換えることにより結合されることが可能である。

【００２１】

J 、 G 、または G^A が 5 員もしくは 6 員窒素芳香族複素環である場合、これは、他に記載がない限りにおいて、いずれかの利用可能な炭素環原子または窒素環原子を介して式 1 の残りに結合していることが可能である。上記のとおり、各 J および G^A は、（とりわけ）独立して、発明の概要において定義されている置換基の群から選択される 1 個以上の置換基で任意により置換されているフェニルであることが可能である。1 ~ 5 個の置換基で任意により置換されているフェニルの例は、提示 1 において $U-1$ （式中、 R^v は、発明の概要において J および G^A について定義されている R^u であると共に、 r は 0 ~ 5 の整数である）と例示されている環である。

【００２２】

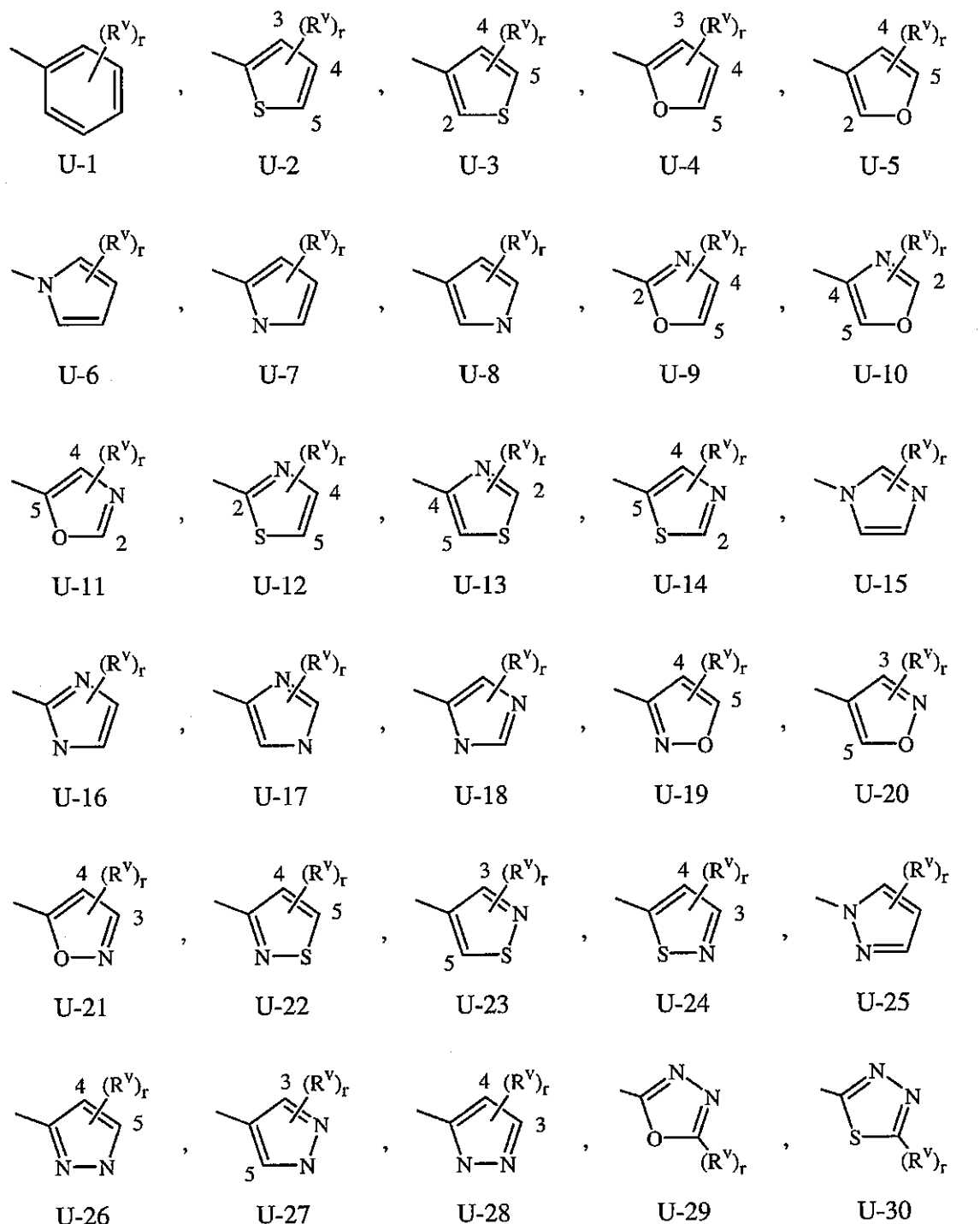
上記のとおり、 J および G^A は、発明の概要において定義されている置換基の群から選択される 1 個以上の置換基で置換されているか、または、任意により置換されている、（とりわけ）5 員もしくは 6 員芳香族複素環であることが可能である。1 個以上の置換基で置換されているか、または、任意により置換されている 5 員もしくは 6 員芳香族複素環の例としては、提示 1 において例示されている環 $U-2 \sim U-61$ （式中、 R^v は、 J および G^A について発明の概要において定義されているいずれかの置換基（すなわち R^u ）であると共に、 r は、各 U 基上の利用可能な位置の数によって限定される 0 ~ 4 の整数である）が挙げられる。 $U-1 \sim U-61$ において、ラジカル $(R^v)_r$ は、発明の概要、な

らびに、すべての実施形態、実施例、表およびスキームにおける $(R^u)_p$ に対応する。下付文字「r」は、U-1~U-61に存在することが可能である R^v (R^u の数を表す「p」に対応する)置換基の数を表す。U-29、U-30、U-36、U-37、U-38、U-39、U-40、U-41、U-42およびU-43が有する利用可能な位置は1つだけであるため、これらのU基について、rは整数0または1に限定されており、rが0であることは、U基は未置換であると共に水素が $(R^v)_r$ により示される位置に存在していることを意味する。

【0023】

【化2】

提示1



10

20

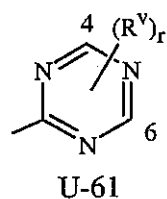
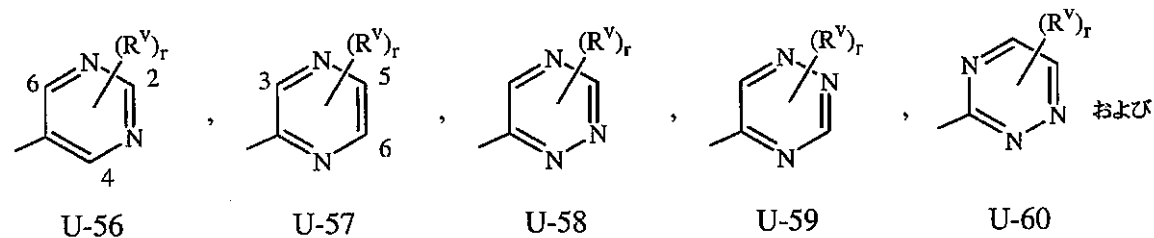
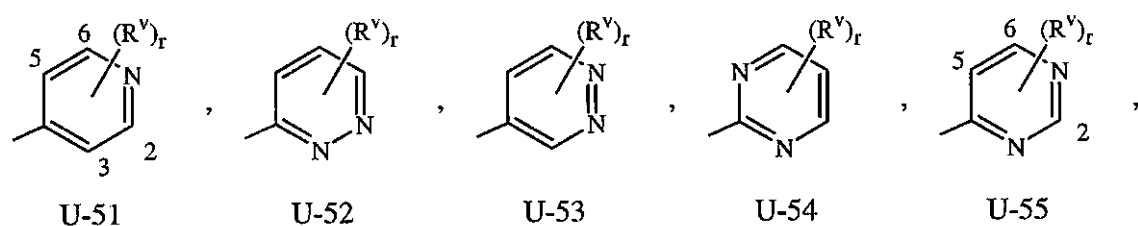
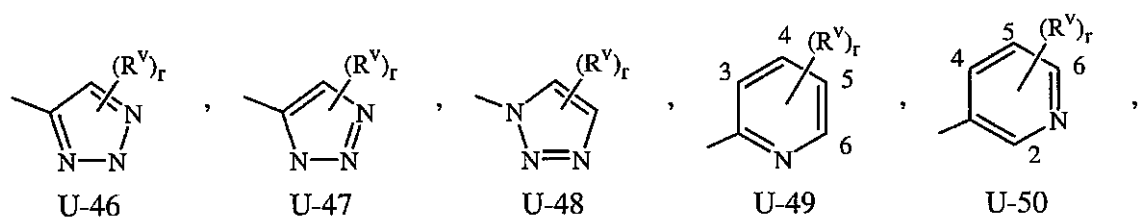
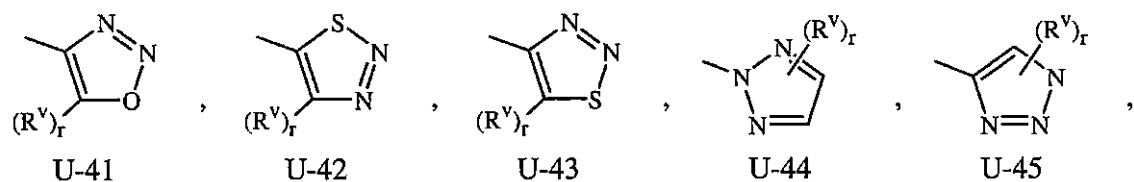
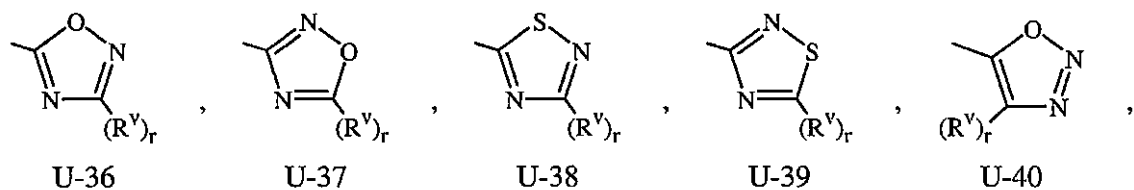
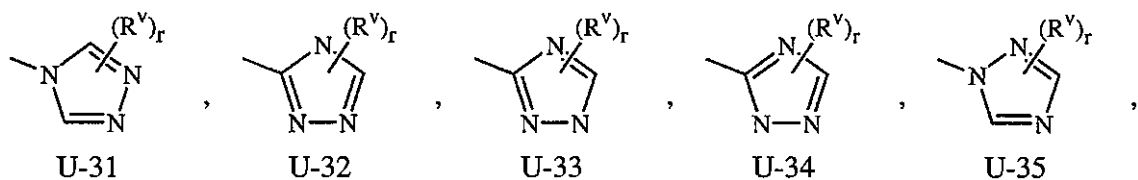
30

40

50

【0024】

【化 3】



【 0 0 2 5 】

R^v (すなわち、R^u) 基が構造 U - 1 ~ U - 61 中に示されているが、これらは任意の置換基であるために存在している必要はないことに注目されたい。原子価を満たすために置換される必要がある窒素原子は、HまたはR^v (すなわち、R^u) で置換されている

10

20

30

40

50

。(R^v)_r (すなわち、(R^u)_p) と U 基との間の結合点が浮いて図示されている場合、(R^v)_r (すなわち、(R^u)_p) は、U 基のいずれかの利用可能な炭素原子または窒素原子に結合されることが可能であることに注目されたい。U 基上の結合点が浮いて図示されている場合、U 基は、水素原子の置き換えによって U 基のいずれかの利用可能な炭素または窒素を介して式 1 の残りに結合されることが可能であることに注目されたい。いくつかの U 基は、4 個未満の R^v 基 (例えば、U - 2 ~ U - 5、U - 7 ~ U - 48、および U - 52 ~ U - 61) でのみ置換されることが可能であることに注目されたい。

【0026】

広く多様な合成方法が技術分野において公知であり、芳香族および非芳香族複素環および環系の調製が可能である；詳細な概説については、8 巻セット *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*、A. R. Katritzky および C. W. Rees 編集長、Pergamon Press、Oxford、1984 年および 12 巻セットの *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*、A. R. Katritzky、C. W. Rees および E. F. V. Scriven 編集長、Pergamon Press、Oxford、1996 年を参照のこと。

10

【0027】

本発明の化合物は、1 つ以上の立体異性体として存在することが可能である。種々の立体異性体としては、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロプ異性体および幾何異性体が挙げられる。当業者は、1 つの立体異性体が、より有効であり得、および / または他の立体異性体に比して濃縮されたとき、もしくは他の立体異性体から分離されたときに有益な効果を示し得ることを理解するであろう。さらに、当業者には、前記立体異性体をどのように分離し、濃縮しおよび / または選択的に調製するかが公知である。本発明の化合物は、立体異性体の混合物、個別の立体異性体として、または光学的に活性な形態として存在し得る。

20

【0028】

当業者は、窒素はオキシドへの酸化に利用可能な孤立電子対を必要とするため、窒素含有複素環のすべてが N - オキシドを形成することが可能であるわけではないことを認識するであろう；当業者は、N - オキシドを形成することが可能である窒素含有複素環を見極めるであろう。当業者はまた、第三級アミンが N - オキシドを形成することが可能であることを認知するであろう。複素環および第三級アミンの N - オキシドの調製のための合成方法は、当業者によってきわめて周知であり、複素環および第三級アミンの、過酢酸および m - クロロ過安息香酸 (MCPBA) などのペルオキシ酸；過酸化水素；t - ブチルヒドロ過酸化物などのアルキルヒドロ過酸化物；過ホウ酸ナトリウム；ならびにジメチルジオキシランなどのジオキシシランでの酸化が挙げられる。N - オキシドの調製のためのこれらの方法は、文献において広範に記載されおよび概説されてきており、例えば：「*Comprehensive Organic Synthesis*」、第 7 巻、748 ~ 750 頁、S. V. Ley 編、Pergamon Press における T. L. Gilchrist；「*Comprehensive Heterocyclic Chemistry*」、第 3 巻、18 ~ 20 頁、A. J. Boulton および A. McKillop 編、Pergamon Press における M. Tisler および B. Stanovnik；「*Advances in Heterocyclic Chemistry*」、第 43 巻、149 ~ 161 頁、A. R. Katritzky 編、Academic Press における M. R. Grimmett および B. R. T. Keene；「*Advances in Heterocyclic Chemistry*」、第 9 巻、285 ~ 291 頁、A. R. Katritzky および A. J. Boulton 編、Academic Press における M. Tisler および B. Stanovnik；および「*Advances in Heterocyclic Chemistry*」、第 22 巻、390 ~ 392 頁、A. R. Katritzky および A. J. Boulton 編、Academic Press における G. W. H. Cheeseman および E. S. G. We

30

40

50

r s t i u k を参照されたい。

【0029】

当業者は、環境において、および、生理的条件下では、化学化合物の塩は対応する非塩形態と平衡状態にあるために、塩は、非塩形態の生物学的実用性を共有することを認識する。それ故、式1の化合物の広く多様な塩が、望ましくない植生を防除するために有用（すなわち、農学的に好適）である。式1の化合物の塩としては、臭化水素酸、塩酸、硝酸、リン酸、硫酸、酢酸、酪酸、フマル酸、乳酸、マレイン酸、マロン酸、シュウ酸、プロピオン酸、サリチル酸、酒石酸、4-トルエンスルホン酸または吉草酸などの無機酸または有機酸での酸付加塩が挙げられる。式1の化合物がカルボン酸またはエノールなどの酸性部分を含有する場合（例えば、 R^3 がHである場合）、塩としてはまた、ピリジン、トリエチルアミンあるいはアンモニア；または、ナトリウム、カリウム、リチウム、カルシウム、マグネシウムまたはバリウムのアミド、水和物、水酸化物あるいは炭酸塩などの有機または無機塩基で形成されるものが挙げられる。従って、本発明は、式1、そのN-オキシドおよび農学的に好適な塩から選択される化合物を含む。

10

【0030】

当業者は、式1の化合物、そのN-オキシドおよび塩は、典型的には2つ以上の形態で存在すると共に、式1、そのN-オキシドおよび塩は、それ故、化合物が表すすべての結晶形および非結晶形を含むことを認識する。非結晶形は、ワックスおよびガムなどの固形分である実施形態、ならびに、溶液および溶融物などの液体である実施形態を含む。結晶形は、基本的に単結晶タイプを表す実施形態および異形体（すなわち、異なる結晶タイプ）の混合物を表す実施形態を含む。「異形体」という用語は、異なる結晶形で結晶化することが可能である化学化合物の特定の結晶形を指し、これらの形態は、結晶格子中において分子の異なる配置および/または立体構造を有する。異形体は同一の化学組成を有することが可能であるが、これらは、格子に弱くまたは強固に結合することが可能である共結晶化水または他の分子の存在または不在によって、異なる組成を有することも可能である。異形体は、結晶形状、密度、硬度、色、化学安定性、融点、吸湿性、懸垂性、溶解速度および生物学的利用可能性などの、化学的、物理的および生物学的特性が異なっていることが可能である。当業者は、式1の化合物またはそのN-オキシドあるいは塩の異形体は、同一の式1の化合物またはそのN-オキシドあるいは塩の他の異形体または異形体の混合物と比して、有益な効果（例えば、有用な配合物の調製に対する好適性、向上した生物学的性能）を発揮することが可能であることを認識するであろう。式1の化合物またはそのN-オキシドあるいは塩の特定の異形体の調製および単離は、例えば、選択された溶剤および温度を用いる結晶化を含む当業者に公知である方法によって達成されることが可能である。

20

30

【0031】

発明の概要に記載の本発明の実施形態は以下に記載のものを含む。以下の実施形態において、式1はそのN-オキシドおよび塩を含み、「式1の化合物」への言及は、実施形態においてさらに定義されていない限りにおいて、発明の概要において特定されている置換基の定義を含む。

【0032】

実施形態1．式1の化合物であって、式中、 R^1 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_6 \sim C_{14}$ シクロアルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキルである。

40

50

【 0 0 3 3 】

実施形態 1 a . 実施形態 1 の化合物であって、式中、 R^1 は、 H 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_6 \sim C_{14}$ シクロアルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキルまたは $C_3 \sim C_{10}$ アルコキシアルコキシアルキルである。

【 0 0 3 4 】

実施形態 2 . 実施形態 1 a の化合物であって、式中、 R^1 は、 H 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルまたは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルである。

【 0 0 3 5 】

実施形態 3 . 実施形態 2 の化合物であって、式中、 R^1 は、 H または $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【 0 0 3 6 】

実施形態 4 . 実施形態 3 の化合物であって、式中、 R^1 は CH_3 である。

【 0 0 3 7 】

実施形態 4 a . 式 1 の化合物であって、式中、 R^1 は $C_4 \sim C_9$ シクロアルキルカルボニルである。

【 0 0 3 8 】

実施形態 4 b . 実施形態 4 a の化合物であって、式中、 R^1 はシクロプロピルカルボニルである。

【 0 0 3 9 】

実施形態 4 c . 式 1 の化合物であって、式中、 R^1 はテトラヒドロピラニルである。

【 0 0 4 0 】

実施形態 5 . 式 1 または実施形態 1 ~ 4 c のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 H 、ハロゲン、シアノ、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_6 \sim C_{14}$ シクロアルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_5 \sim C_{12}$ シクロアルキルアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ。

【 0 0 4 1 】

実施形態 5 a . 実施形態 5 の化合物であって、式中、 R^2 は、 H 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_6 \sim C_{14}$ シクロアルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシである。

10

20

30

40

50

【 0 0 4 2 】

実施形態 5 b . 実施形態 5 の化合物であって、式中、 R^2 は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキルまたは $C_1 \sim C_4$ アルコキシである。

【 0 0 4 3 】

実施形態 5 c . 実施形態 5 b の化合物であって、式中、 R^2 は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ アルコキシである。

【 0 0 4 4 】

実施形態 5 d . 実施形態 5 c の化合物であって、式中、 R^2 は、H、Cl、 CH_3 、Et または OMe である。

10

【 0 0 4 5 】

実施形態 6 . 実施形態 5 の化合物であって、式中、 R^2 は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルまたは $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキルである。

【 0 0 4 6 】

実施形態 7 . 実施形態 6 の化合物であって、式中、 R^2 は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【 0 0 4 7 】

実施形態 8 . 実施形態 7 の化合物であって、式中、 R^2 は、H、Cl、 CH_3 または Et (すなわち CH_2CH_3) である。

20

【 0 0 4 8 】

実施形態 9 . 実施形態 5 d または 8 の化合物であって、式中、 R^2 は H である。

【 0 0 4 9 】

実施形態 10 . 実施形態 5 d または 8 の化合物であって、式中、 R^2 は Cl である。

【 0 0 5 0 】

実施形態 11 . 実施形態 5 d または 8 の化合物であって、式中、 R^2 は CH_3 である。

【 0 0 5 1 】

実施形態 12 . 式 1 または実施形態 1 ~ 11 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 R^3 は、H、 $-C(=W^6)R^4$ 、 $-C(=W^2)W^3R^5$ 、 $-S(=O)_2R^6$ または $-C(=W^5)NR^9R^{10}$ である。

30

【 0 0 5 2 】

実施形態 12 a . 実施形態 12 の化合物であって、式中、 R^3 は、H、 $-CO_2-i-Pr$ (すなわち $-CO_2CH(CH_3)_2$)、 $-CO_2-i-Bu$ (すなわち $-CO_2CH_2CH(CH_3)_2$)、 $CO-(2-クロロフェニル)$ または $-CO-c-Pr$ (すなわち $-C(O)-シクロプロピル$) である。

【 0 0 5 3 】

実施形態 12 b . 実施形態 12 a の化合物であって、式中、 R^3 は、H、 CO_2-i-Pr または $CO-t-Bu$ である。

【 0 0 5 4 】

実施形態 12 c . 実施形態 12 b の化合物であって、式中、 R^3 は、H または CO_2-i-Pr である。

40

【 0 0 5 5 】

実施形態 13 . 実施形態 12 の化合物であって、式中、 R^3 は H である。

【 0 0 5 6 】

実施形態 14 . 実施形態 12 の化合物であって、式中、 R^3 は $-C(=W^6)R^4$ である。

【 0 0 5 7 】

実施形態 15 . 実施形態 12 の化合物であって、式中、 R^3 は $-C(=W^2)W^3R^5$ である。

【 0 0 5 8 】

50

実施形態 16 . 実施形態 12 の化合物であって、式中、 R^3 は $-S(=O)_2R^6$ である。

【0059】

実施形態 17 . 実施形態 12 の化合物であって、式中、 R^3 は $-C(=W^5)NR^9R^{10}$ である。

【0060】

実施形態 18 . 式 1 または実施形態 1 ~ 17 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、化合物は塩の形態である。

【0061】

実施形態 18 a . 式 1 または実施形態 1 ~ 18 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 W^6 は、独立して O である。

10

【0062】

実施形態 18 b . 式 1 または実施形態 1 ~ 18 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 W^6 は独立して S である。

【0063】

実施形態 19 . 式 1 または実施形態 1 ~ 18 b のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 R^4 は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、ナフタレニルまたは $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ である。

20

【0064】

実施形態 20 . 実施形態 19 の化合物であって、式中、各 R^4 は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、ナフタレニルまたは $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ である。

【0065】

実施形態 21 . 実施形態 20 の化合物であって、式中、各 R^4 は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

30

【0066】

実施形態 22 . 実施形態 21 の化合物であって、式中、各 R^4 は t - Bu (すなわち $C(CH_3)_3$) である。

【0067】

実施形態 23 . 式 1 または実施形態 1 ~ 22 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 W^2 は O である。

【0068】

実施形態 24 . 式 1 または実施形態 1 ~ 22 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 W^2 は S である。

【0069】

実施形態 25 . 式 1 または実施形態 1 ~ 24 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 W^3 は O である。

40

【0070】

実施形態 26 . 式 1 または実施形態 1 ~ 24 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 W^3 は S である。

【0071】

実施形態 27 . 式 1 または実施形態 1 ~ 26 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 R^5 は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシク

50

ロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、ナフタレニルまたは $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ である。

【0072】

実施形態 28 . 実施形態 27 の化合物であって、式中、各 R^5 は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、ナフタレニルまたは $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ である。

【0073】

実施形態 29 . 実施形態 28 の化合物であって、式中、各 R^5 は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

10

【0074】

実施形態 30 . 実施形態 29 の化合物であって、式中、各 R^5 は、独立して、 CH_3 または $i-Pr$ (すなわち $CH(CH_3)_2$) である。

【0075】

実施形態 31 . 式 1 または実施形態 1 ~ 30 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 R^6 は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ハロジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニルアミノ、ナフタレニルまたは $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ である。

20

【0076】

実施形態 32 . 実施形態 31 の化合物であって、式中、各 R^6 は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、ナフタレニルまたは $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ である。

30

【0077】

実施形態 33 . 実施形態 32 の化合物であって、式中、各 R^6 は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0078】

実施形態 34 . 実施形態 33 の化合物であって、式中、各 R^6 は CH_3 である。

【0079】

実施形態 35 . 式 1 または実施形態 1 ~ 34 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 W^5 は O である。

【0080】

実施形態 36 . 式 1 または実施形態 1 ~ 34 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 W^5 は S である。

40

【0081】

実施形態 37 . 式 1 または実施形態 1 ~ 36 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 R^9 は、独立して、 H 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、ナフタレニルまたは $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ である。

【0082】

実施形態 38 . 実施形態 37 の化合物であって、式中、各 R^9 は、独立して、 H 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロ

50

シクロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、ナフタレニルまたは $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ である。

【0083】

実施形態39．実施形態38の化合物であって、式中、各 R^9 は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0084】

実施形態40．実施形態39の化合物であって、式中、各 R^9 は、独立して、Hまたは CH_3 である。

【0085】

実施形態41．実施形態40の化合物であって、式中、各 R^9 はHである。

10

【0086】

実施形態42．実施形態41の化合物であって、式中、各 R^9 は CH_3 である。

【0087】

実施形態43．式1または実施形態1～42のいずれか1つの化合物であって、式中、各 R^{10} は、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルまたは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルである。

【0088】

実施形態44．実施形態43の化合物であって、式中、各 R^{10} は、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルまたは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルである。

【0089】

20

実施形態45．実施形態44の化合物であって、式中、各 R^{10} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0090】

実施形態46．実施形態45の化合物であって、式中、各 R^{10} は、独立して、Hまたは CH_3 である。

【0091】

実施形態47．実施形態46の化合物であって、式中、各 R^{10} はHである。

【0092】

実施形態48．式1または実施形態1～36のいずれか1つの化合物であって、式中、 R^9 および R^{10} が、これらが結合している窒素と一緒になって複素環を形成している場合、環は、5員～6員であると共に、結合窒素に追加して、炭素、ならびに、任意によりO、Sおよび NR^{13} から選択される環員を含有し、炭素環員は任意により $C(=O)$ の形態であると共に、環は、炭素環員上で、ハロゲン、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルキルおよび $C_1 \sim C_3$ アルコキシからなる群から独立して選択される4個以下の置換基で任意により置換されている。

30

【0093】

実施形態49．実施形態48の化合物であって、式中、 R^9 および R^{10} が、これらが結合している窒素と一緒になって複素環を形成している場合、環は、5員～6員であると共に、結合窒素に追加して、炭素、ならびに、任意によりOおよびSから選択される環員を含有し、炭素環員は任意により $C(=O)$ の形態であると共に、環は、炭素環員上で、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキルおよび $C_1 \sim C_3$ アルコキシからなる群から独立して選択される3個以下の置換基で任意により置換されている。

40

【0094】

実施形態50．実施形態49の化合物であって、式中、 R^9 および R^{10} が、これらが結合している窒素と一緒になって複素環を形成している場合、環は、5員～6員であると共に、結合窒素に追加して、炭素および任意によりOから選択される環員を含有し、環は、炭素環員上で、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルからなる群から独立して選択される3個以下の置換基で任意により置換されている。

【0095】

実施形態51．式1または実施形態1～50のいずれか1つの化合物であって、式中、

50

化合物は金属塩の形態である。

【0096】

実施形態52．式1または実施形態1～50のいずれか1つの化合物であって、式中、化合物はアンモニウム塩の形態である。

【0097】

実施形態53．実施形態51の化合物であって、式中、金属塩はアルカリ金属塩である。

【0098】

実施形態54．実施形態53の化合物であって、式中、金属塩は、ナトリウムまたはカリウム塩である。

10

【0099】

実施形態54a．式1または実施形態1～54のいずれか1つの化合物であって、式中、Gはフェニル以外である。

【0100】

実施形態55．式1または実施形態1～54のいずれか1つの化合物であって、式中、Gは、フェニル環、または、5員もしくは6員芳香族複素環であって、各環は、窒素環員上のR^xで任意により置換されていると共に、炭素環員上のR^wから選択される2個以下の置換基で任意により置換されている。

【0101】

実施形態55a．式1または実施形態1～55のいずれか1つの化合物であって、式中、各R^xは、独立して、HまたはC₁～C₃アルキルである。

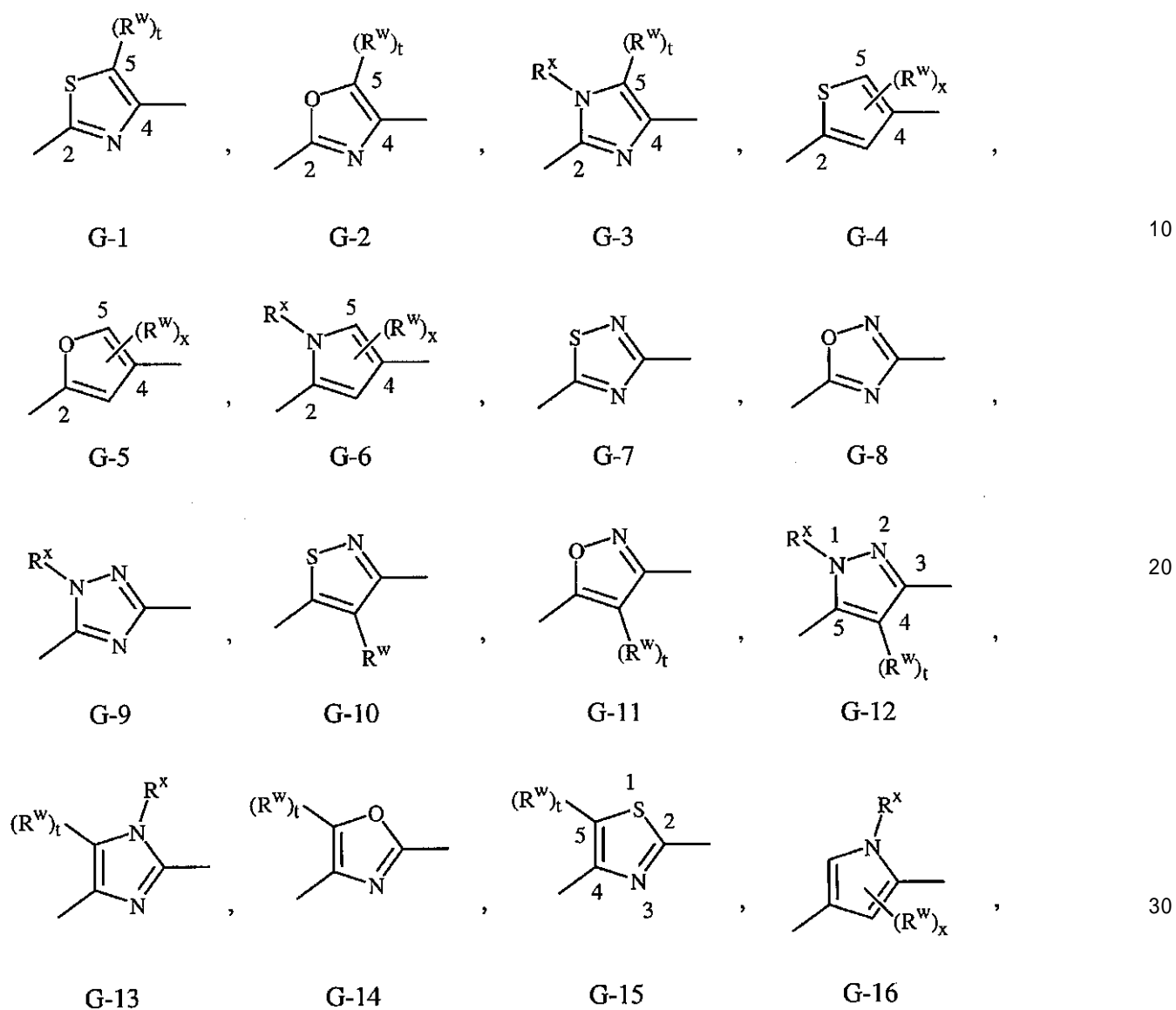
20

【0102】

実施形態56．式1または実施形態1～55aのいずれか1つの化合物であって、式中、Gは、提示2；

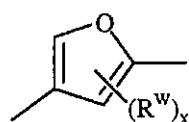
【化 4】

提示 2

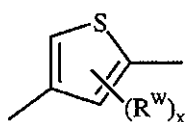


【 0 1 0 3 】

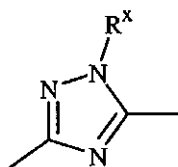
【化 5】



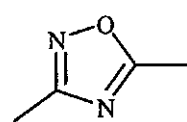
G-17



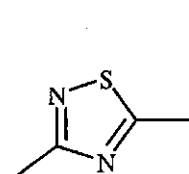
G-18



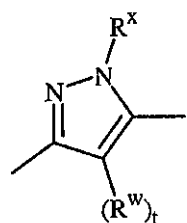
G-19



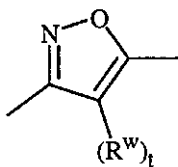
G-20



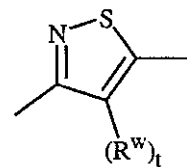
G-21



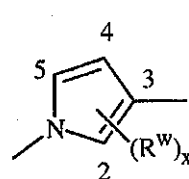
G-22



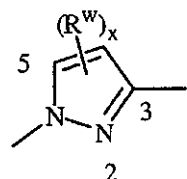
G-23



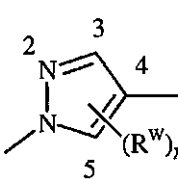
G-24



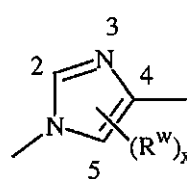
G-25



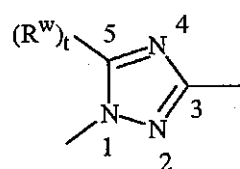
G-26



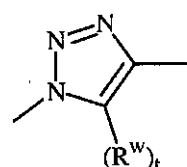
G-27



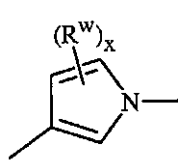
G-28



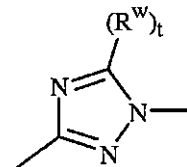
G-29



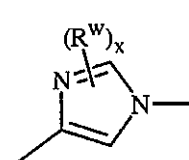
G-30



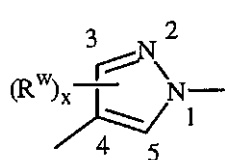
G-31



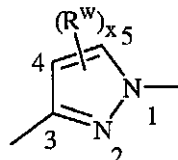
G-32



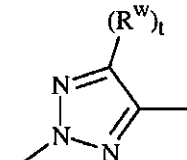
G-33



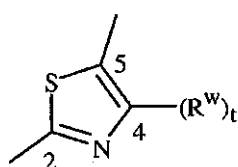
G-34



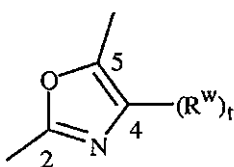
G-35



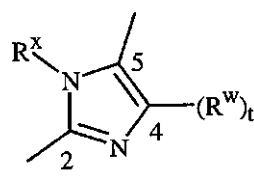
G-36



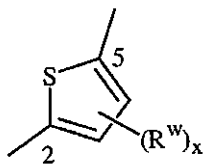
G-37



G-38



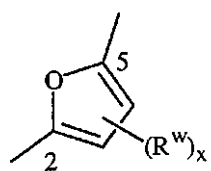
G-39



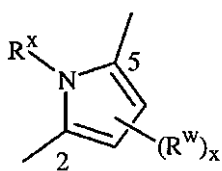
G-40

【 0 1 0 4 】

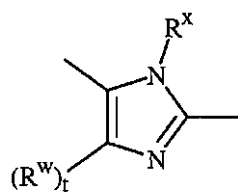
【化 6】



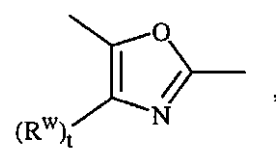
G-41



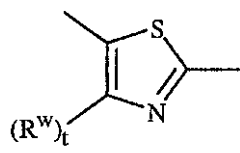
G-42



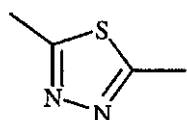
G-43



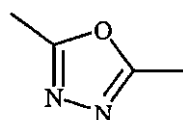
G-44



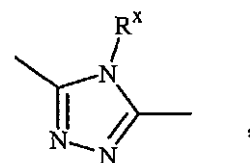
G-45



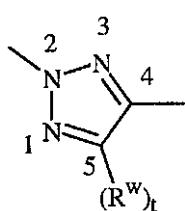
G-46



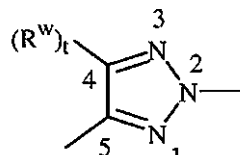
G-47



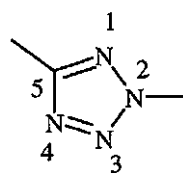
G-48



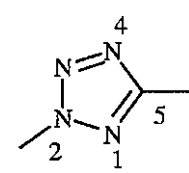
G-49



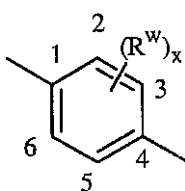
G-50



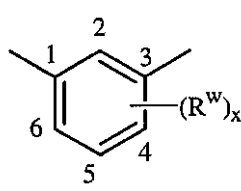
G-51



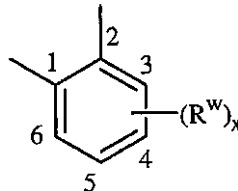
G-52



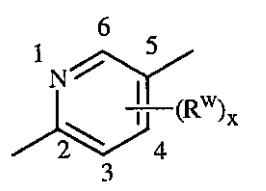
G-53



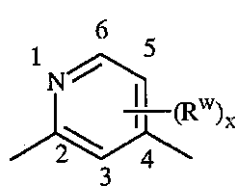
G-54



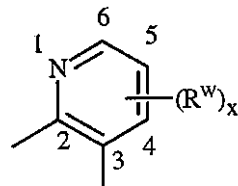
G-55



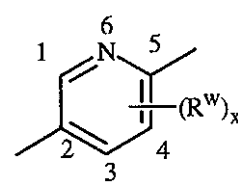
G-56



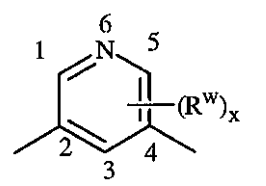
G-57



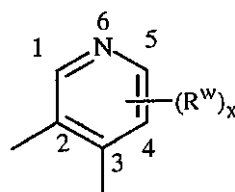
G-58



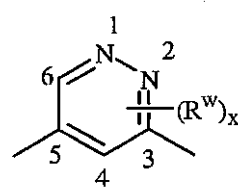
G-59



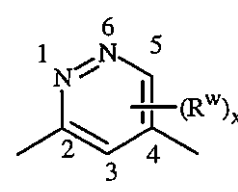
G-60



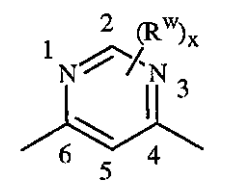
G-61



G-62



G-63



G-64

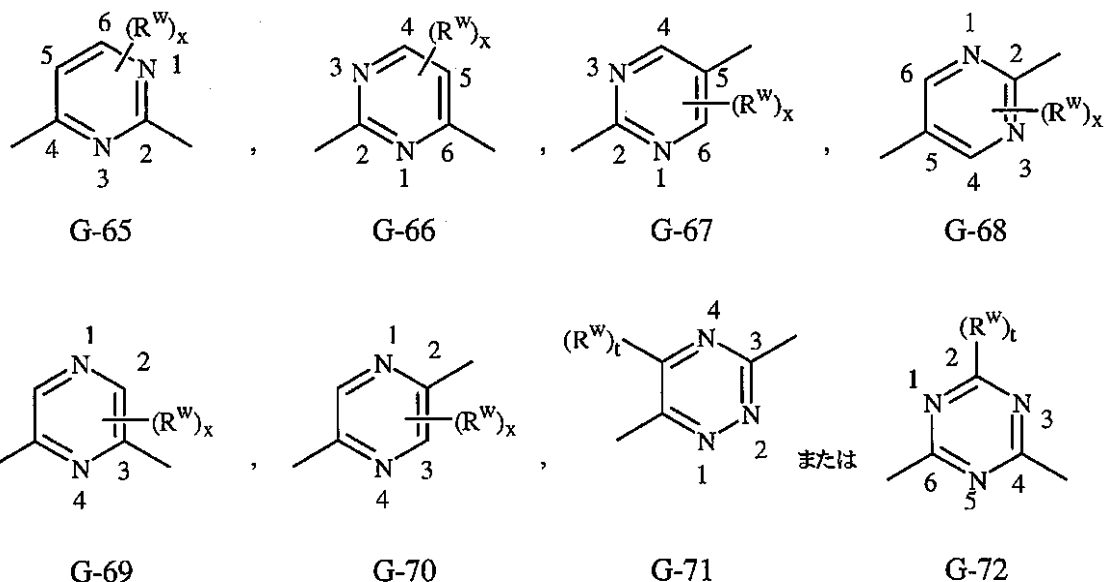
10

20

30

40

【化 7】



10

20

(式中、左側に突出している結合は式 1 のピリダジノン環に結合されていると共に、右側に突出している結合は J に結合しており；および、 x は、0 ~ 2 から選択される整数である)

に示されている G - 1 ~ G - 72 の 1 つである。

【0106】

実施形態 57 . 実施形態 56 の化合物であって、式中、G は、G の 2 位以外の箇所て J に結合している。

【0107】

実施形態 57 a . 実施形態 56 の化合物であって、式中、G は、G の 3 位または 4 位で J に結合している。

【0108】

実施形態 57 b . 実施形態 56 ~ 57 a のいずれか 1 つの化合物であって、式中、G は、G - 3 ~ G - 6、G - 9 ~ G - 18、G - 22 ~ G - 31、G - 33 ~ G - 35、G - 39 ~ G - 45、G - 48、G - 50、G - 53 ~ G - 60、G - 62 ~ G - 65 および G - 68 ~ G - 71 から選択される。

30

【0109】

実施形態 58 . 実施形態 57 b の化合物であって、式中、G は、G - 12 ~ G - 15、G - 26 ~ G - 29、G - 34、G - 35、G - 54 および G - 65 から選択される。

【0110】

実施形態 59 . 実施形態 58 の化合物であって、式中、G は、G - 12、G - 15、G - 26、G - 28、G - 29、G - 34、G - 35、G - 54 および G - 65 から選択される。

40

【0111】

実施形態 60 . 実施形態 56 ~ 59 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 x は 1 である。

【0112】

実施形態 61 . 実施形態 56 ~ 59 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 x は 2 である。

【0113】

実施形態 62 . 実施形態 56 ~ 59 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、少なくとも 1 つの R^w は、G 基のピリダジノン環への結合に近接して位置されている。

【0114】

50

実施形態 63 . 実施形態 56 ~ 60 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、G は G - 26 である。

【0115】

実施形態 64 . 実施形態 56 ~ 59 または 63 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、x は 1 であると共に、R^w は G - 26 の 5 位に位置されている。

【0116】

実施形態 65 . 実施形態 56 ~ 59 または 63 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、x は 2 であると共に、R^w は G - 26 の 4 位および 5 位に位置されている。

【0117】

実施形態 66 . 実施形態 56 ~ 59 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、G は G - 15 である。

10

【0118】

実施形態 67 . 実施形態 56 ~ 59 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、G は G - 29 である。

【0119】

実施形態 68 . 実施形態 56 ~ 59 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、G は G - 28 であり、x は 1 であると共に、R^w は G - 28 の 2 位に位置されている。

【0120】

実施形態 69 . 実施形態 56 ~ 59 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、G は G - 28 であり、x は 2 であると共に、R^w は G - 28 の 2 位および 5 位に位置されている。

20

【0121】

実施形態 69a . 実施形態 56 ~ 57b のいずれか 1 つの化合物であって、式中、G は G - 45 である。

【0122】

実施形態 70 . 実施形態 56 ~ 59 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、G は G - 54 であり、x は 1 であると共に、R^w は G - 54 の 6 位に位置されている。

【0123】

実施形態 71 . 実施形態 56 ~ 59 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、G は G - 54 であり、x は 2 であると共に、R^w は G - 54 の 2 位および 6 位に位置されている。

【0124】

30

実施形態 72 . 実施形態 56 ~ 59 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、G は G - 65 であり、x は 1 であると共に、R^w は G - 65 の 5 位に位置されている。

【0125】

実施形態 73 . 実施形態 56 ~ 59 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、G は G - 35 であり、x は 1 であると共に、R^w は G - 35 の 4 位に位置されている。

【0126】

実施形態 74 . 実施形態 56 ~ 59 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、G は G - 34 であり、x は 1 であると共に、R^w は G - 34 の 3 位に位置されている。

【0127】

実施形態 75 . 実施形態 56 ~ 59 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、G は G - 12 である。

40

【0128】

実施形態 76 . 式 1 または実施形態 1 ~ 75 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 R^w は、独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、-CHO、-C(=O)OH、SF₅、C₁ ~ C₆ アルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₂ ~ C₆ アルキニル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₃ ~ C₈ ハロシクロアルキル、C₄ ~ C₁₀ アルキルシクロアルキル、C₄ ~ C₁₀ シクロアルキルアルキル、C₄ ~ C₁₀ ハロシクロアルキルアルキル、C₅ ~ C₁₂ アルキルシクロアルキルアルキル、C₂ ~ C₈ アルキルカルボニル、C₂ ~ C₈ ハロアルキルカルボニル、C₂ ~ C₈ アルコキシカルボニル、C₂ ~ C₈ アルキルアミノカルボニル、C₃ ~ C₁₀ ジアルキルアミ

50

ノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルアミノ、ナフタレニル、 $-O(CR^{11}R^{12})_nG^A$ または $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ である。

【0129】

実施形態 77 . 実施形態 76 の化合物であって、式中、各 R^w は、独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-O(CR^{11}R^{12})_nG^A$ または $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ である。

10

【0130】

実施形態 77 a . 実施形態 77 の化合物であって、式中、各 R^w は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-O(CR^{11}R^{12})_nG^A$ または $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ である。

【0131】

実施形態 78 . 実施形態 77 a の化合物であって、式中、各 R^w は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $-O(CR^{11}R^{12})_nG^A$ である。

【0132】

20

実施形態 79 . 実施形態 63 の化合物であって、式中、各 R^w は、独立して、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0133】

実施形態 79 a . 実施形態 79 の化合物であって、式中、各 R^w は、独立して、ハロゲン、 CH_3 、Et、または $n-Pr$ (すなわち $-(CH_2)_2CH_3$) である。

【0134】

実施形態 80 . 実施形態 79 a の化合物であって、式中、各 R^w は、独立して、ハロゲン、 CH_3 または Et (すなわち CH_2CH_3) である。

【0135】

実施形態 81 . 実施形態 80 の化合物であって、式中、各 R^w は、独立して、 CH_3 または Et である。

30

【0136】

実施形態 82 . 式 1 または実施形態 1 ~ 81 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 n は、独立して、0 ~ 1 から選択される整数である。

【0137】

実施形態 83 . 実施形態 82 の化合物であって、式中、各 n は 0 である。

【0138】

実施形態 84 . 式 1 または実施形態 1 ~ 83 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 J は、フェニル環または 5 員もしくは 6 員芳香族複素環であって、各環は、 R^u から独立して選択される 3 個以下の置換基で任意により置換されている。

40

【0139】

実施形態 85 . 実施形態 84 の化合物であって、式中、 J は、フェニル環または 6 員芳香族複素環であって、各環は、 R^u から独立して選択される 3 個以下の置換基で任意により置換されている。

【0140】

実施形態 86 . 実施形態 85 の化合物であって、式中、 J は、フェニル環であって、 R^u から独立して選択される 3 個以下の置換基で任意により置換されている。

【0141】

実施形態 87 . 実施形態 86 の化合物であって、式中、 J は、 R^u から選択される置換基で置換されているフェニル環である。

50

【 0 1 4 2 】

実施形態 8 8 . 実施形態 8 7 の化合物であって、式中、J は、パラ位で、R^u から選択される置換基で置換されているフェニル環である。

【 0 1 4 3 】

実施形態 8 8 a . 式 1 または実施形態 1 ~ 8 3 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、J は、3 位、4 位または 5 位で、ハロゲンまたは C₁ ~ C₆ ハロアルキルで置換されているフェニルである。

【 0 1 4 4 】

実施形態 8 9 . 式 1 の化合物であって、式中、各 G^A は、独立して、フェニル環または 5 員もしくは 6 員芳香族複素環であって、各環は、R^u から独立して選択される 5 個以下の置換基で任意により置換されている。

10

【 0 1 4 5 】

実施形態 8 9 a . 実施形態 8 9 の化合物であって、式中、各 G^A は、独立して、フェニル環または 5 員もしくは 6 員芳香族複素環であって、各環は、R^u から独立して選択される 3 個以下の置換基で任意により置換されている。

【 0 1 4 6 】

実施形態 9 0 . 実施形態 8 9 の化合物であって、式中、各 G^A は、独立して、フェニル環または 5 員もしくは 6 員芳香族複素環であって、各環は、R^u から独立して選択される 1 個以下の置換基で任意により置換されている。

20

【 0 1 4 7 】

実施形態 9 1 . 式 1 または実施形態 1 ~ 9 0 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 R^u は、独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、-CHO、-C(=O)OH、-C(=O)NH₂、-SO₂NH₂、SF₅、C₁ ~ C₆ アルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₂ ~ C₆ アルキニル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₃ ~ C₈ ハロシクロアルキル、C₂ ~ C₈ アルキルカルボニル、C₂ ~ C₈ ハロアルキルカルボニル、C₂ ~ C₈ アルコキシカルボニル、C₂ ~ C₈ アルキルアミノカルボニル、C₃ ~ C₁₀ ジアルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルコキシ、C₁ ~ C₆ ハロアルコキシ、C₂ ~ C₈ アルキルカルボニルオキシ、C₁ ~ C₆ アルキルチオ、C₁ ~ C₆ ハロアルキルチオ、C₁ ~ C₆ アルキルスルホニル、C₁ ~ C₆ ハロアルキルスルホニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノスルホニル、C₂ ~ C₈ ジアルキルアミノスルホニル、C₁ ~ C₆ アルキルアミノ、C₂ ~ C₈ ジアルキルアミノ、C₂ ~ C₈ アルキルカルボニルアミノ、C₁ ~ C₆ アルキルスルホニルアミノ、フェニル、ピリジニルまたはチエニルである。

30

【 0 1 4 8 】

実施形態 9 2 . 実施形態 9 1 の化合物であって、式中、各 R^u は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、-CHO、-C(=O)OH、C₁ ~ C₆ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₃ ~ C₈ ハロシクロアルキル、C₁ ~ C₆ アルコキシ、C₁ ~ C₆ ハロアルコキシ、C₁ ~ C₆ アルキルアミノ、C₂ ~ C₈ ジアルキルアミノまたはフェニルである。

【 0 1 4 9 】

40

実施形態 9 3 . 実施形態 9 2 の化合物であって、式中、各 R^u は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ ~ C₆ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₁ ~ C₆ アルコキシまたは C₁ ~ C₆ ハロアルコキシである。

【 0 1 5 0 】

実施形態 9 4 . 実施形態 9 3 の化合物であって、式中、各 R^u は、独立して、ハロゲン、C₁ ~ C₆ アルキルまたは C₁ ~ C₆ ハロアルキルである。

【 0 1 5 1 】

実施形態 9 5 . 実施形態 9 4 の化合物であって、式中、各 R^u は、独立して、ハロゲン、C₁ ~ C₃ アルキルまたは C₁ ~ C₃ ハロアルキルである。

【 0 1 5 2 】

50

実施形態 96 . 実施形態 95 の化合物であって、式中、各 R^u は、独立して、 C_1 、 B_r または CF_3 である。

【0153】

実施形態 97 . 式 1 または実施形態 1 ~ 96 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 W^1 は O である。

【0154】

実施形態 98 . 式 1 または実施形態 1 ~ 96 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 W^1 は S である。

【0155】

上記の実施形態 1 ~ 98 ならびに本明細書に記載のいずれかの他の実施形態を含む本発明の実施形態は、いずれかの様式で組み合わせることが可能であり、実施形態における可変要素の記載は、式 1 の化合物のみではなく、式 1 の化合物を調製するのに有用な出発化合物および中間体化合物にも関連する。加えて、上記の実施形態 1 ~ 98 ならびに本明細書に記載のいずれかの他の実施形態を含む本発明の実施形態、およびこれらのいずれかの組み合わせは、本発明の組成物および方法に関連する。

10

【0156】

実施形態 1 ~ 98 の組み合わせが以下により例示されている。

実施形態 A1 . 式 1 の化合物であって、式中、

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_6 \sim C_{14}$ シクロアルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキルまたは $C_3 \sim C_{10}$ アルコキシアルコキシアルキルであり；

20

R^2 は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルまたは $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキルであり；

R^3 は、H、 $-C(=W^6)R^4$ 、 $-C(=W^2)W^3R^5$ 、 $-S(=O)_2R^6$ または $-C(W^5)NR^9R^{10}$ であり；

各 R^x は、独立して、H または $C_1 \sim C_3$ アルキルであり；

30

J は、フェニル環または 5 員もしくは 6 員芳香族複素環であって、各環は、 R^u から独立して選択される 3 個以下の置換基で任意により置換されており；ならびに

各 R^u は、独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 SF_5 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルアミノ、フェニル、ピリジニルまたはチエニルである。

40

【0157】

実施形態 A2 . 実施形態 A1 の化合物であって、式中、

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルまたは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルであり；

R^2 は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

G は、G - 3 ~ G - 6、G - 9 ~ G - 18、G - 22 ~ G - 31、G - 33 ~ G - 35

50

、G - 39 ~ G - 45、G - 48、G - 50、G - 53 ~ G - 60、G - 62 ~ G - 65
 および G - 68 ~ G - 71 (式中、左側に突出している結合は式1のピリダジノン環に結合していると共に、右側に突出している結合はJに結合している)から選択され；ならびに、xは、0 ~ 2から選択される整数であり；

各 R^w は、独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-O(CR^{11}R^{12})_nG^A$ または $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ であり；

Jは、 R^u から独立して選択される3個以下の置換基で任意により置換されているフェニル環であり；

各 R^u は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノまたはフェニルであり；ならびに

W^1 はOである。

【0158】

実施形態A3．実施形態A2の化合物であって、式中、

R^1 は、Hまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

R^2 は、H、Cl、 CH_3 またはEtであり；

R^3 は、Hまたは CO_2-i-Pr であり；

Gは、G - 12 ~ G - 15、G - 26 ~ G - 29、G - 34、G - 35、G - 54およびG - 65から選択され；

各 R^w は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $-O(CR^{11}R^{12})_nG^A$ であり；

Jは、 R^u から選択される置換基で置換されているフェニル環であり；ならびに

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

【0159】

実施形態A4．式1の化合物であって、式中、

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_6 \sim C_{14}$ シクロアルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキルアルキル、 $C_5 \sim C_{12}$ アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシアルキルまたは $C_3 \sim C_{10}$ アルコキシアルコキシアルキルであり；

R^2 は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキルまたは $C_1 \sim C_4$ アルコキシであり；

R^3 は、H、 $-C(=W^6)R^4$ 、 $-C(=W^2)W^3R^5$ 、 $-S(=O)_2R^6$ または $-C(W^5)NR^9R^{10}$ であり；

Gは、フェニル環または5員もしくは6員芳香族複素環であって、各環は、窒素環員上の R^x で任意により置換されていると共に、炭素環員上の R^w から選択される2個以下の置換基で任意により置換されており；

各 R^x は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_3$ アルキルであり；

Jは、フェニル環または5員もしくは6員芳香族複素環であって、各環は、 R^u から独立して選択される3個以下の置換基で任意により置換されており；ならびに

各 R^u は、独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 SF_5 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルア

10

20

30

40

50

ミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルアミノ、フェニル、ピリジニルまたはチエニルである。

【0160】

実施形態 A 5 . 実施形態 A 4 の化合物であって、式中、

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルまたは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルであり；

R^2 は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ アルコキシであり；

G は、G - 3 ~ G - 6、G - 9 ~ G - 18、G - 22 ~ G - 31、G - 33 ~ G - 35、G - 39 ~ G - 45、G - 48、G - 50、G - 53 ~ G - 60、G - 62 ~ G - 65 および G - 68 ~ G - 71 から選択され（式中、左側に突出している結合は式 1 のピリダジノン環に結合していると共に、右側に突出している結合は J に結合している）；ならびに、x は、0 ~ 2 から選択される整数であり；

各 R^w は、独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-O(CR^{11}R^{12})_nG^A$ または $-(CR^{11}R^{12})_nG^A$ であり；

J は、 R^u から独立して選択される 3 個以下の置換基で任意により置換されているフェニル環であり；

各 R^u は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノまたはフェニルであり；ならびに

W^1 は O である。

【0161】

実施形態 A 6 . 実施形態 A 5 の化合物であって、式中、

R^1 は、H または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

R^2 は、H、Cl、 CH_3 、Et または OMe であり；

R^3 は、H、 CO_2-i-Pr または $CO-t-Bu$ であり；

G は、G - 12 ~ G - 15、G - 26 ~ G - 29、G - 34、G - 35、G - 54 および G - 65 から選択され；

各 R^w は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $-O(CR^{11}R^{12})_nG^A$ であり；

J は、 R^u から選択される置換基で置換されているフェニル環であり；および

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

【0162】

実施形態 A 7 . 実施形態 A 3 または A 6 の化合物であって、式中、

R^1 は CH_3 であり；

R^2 は H であり；

G は、G - 12、G - 15、G - 26、G - 28、G - 29、G - 34、G - 35、G - 54 および G - 65 から選択され；

各 R^w は、独立して CH_3 または Et であり；

J は、パラ位で、 R^u から選択される置換基で置換されているフェニル環であり；ならびに

各 R^u は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルである。

【 0 1 6 3 】

実施形態 A 8 . 実施形態 A 7 の化合物であって、式中、

G は G - 2 6 であり；

x は 1 であり；

R^w は G - 2 6 の 5 位に位置されており；および

各 R^u は、独立して、C l、B r または C F₃ である。

【 0 1 6 4 】

特定の実施形態は：

5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 4 - [5 - メチル - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 1)、

4 - [3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 3)、

5 - [3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 , 6 - ジヒドロ - 1 - メチル - 6 - オキソ - 4 - ピリダジニル - 1 - メチルエチルカーボネート (化合物 7)、

からなる群から選択される式 1 の化合物を含むと共に：

4 - [3 - (4 - ブロモフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 5 - ヒドロキシ - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 7 8)、

4 - [5 - エチル - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 1 1)

および

4 - [3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - エチル - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 2 6)

からなる群から選択される式 1 の化合物をも含む。

【 0 1 6 5 】

注目すべきは、式 1 の化合物であって、式中、

R¹ は、H、C₁ ~ C₆ アルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₂ ~ C₆ アルキニル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₂ ~ C₆ ハロアルケニル、C₂ ~ C₆ ハロアルキニル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₃ ~ C₈ ハロシクロアルキル、C₄ ~ C₁₀ アルキルシクロアルキル、C₄ ~ C₁₀ シクロアルキルアルキル、C₆ ~ C₁₄ シクロアルキルシクロアルキル、C₄ ~ C₁₀ ハロシクロアルキルアルキル、C₅ ~ C₁₂ アルキルシクロアルキルアルキル、C₃ ~ C₈ シクロアルケニル、C₃ ~ C₈ ハロシクロアルケニル、C₂ ~ C₈ アルコキシアルキル、C₄ ~ C₁₀ シクロアルコキシアルキル、C₃ ~ C₁₀ アルコキシアルコキシアルキル、C₂ ~ C₈ アルキルチオアルキル、C₂ ~ C₈ アルキルスルフィニルアルキルまたは C₂ ~ C₈ アルキルスルホニルアルキルであり；

R² は、H、ハロゲン、シアノ、- C (= O) OH、- C (= O) NH₂、C₁ ~ C₆ アルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₂ ~ C₆ アルキニル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₂ ~ C₆ ハロアルケニル、C₂ ~ C₆ ハロアルキニル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₃ ~ C₈ ハロシクロアルキル、C₄ ~ C₁₀ アルキルシクロアルキル、C₄ ~ C₁₀ シクロアルキルアルキル、C₆ ~ C₁₄ シクロアルキルシクロアルキル、C₄ ~ C₁₀ ハロシクロアルキルアルキル、C₅ ~ C₁₂ アルキルシクロアルキルアルキル、C₃ ~ C₈ シクロアルケニル、C₃ ~ C₈ ハロシクロアルケニル、C₂ ~ C₈ アルコキシアルキル、C₄ ~ C₁₀ シクロアルコキシアルキル、C₃ ~ C₁₀ アルコキシアルコキシアルキル、C₂ ~ C₈ アルキルチオアルキル、C₂ ~ C₈ アルキルスルフィニルアルキル、C₂ ~ C₈ アルキルスルホニルアルキル、C₂ ~ C₈ アルコキシカルボニル、C₄ ~ C₁₀ シクロアルコキシカルボニル、C₅ ~ C₁₂ シクロアルキルアルコキシカルボニル、C₂ ~ C₈ アルキルアミノカルボニル、C₃ ~ C₁₀ ジアルキルアミノカルボニル、C₄ ~ C₁₀ シクロアルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₆ アルコキシ、C₁ ~ C₆ ハロアルコキシ、C₁ ~ C₆ アルキルチオまたは C₁ ~ C₆ ハロアルキルチオであり；

R³ は、H、- C (= O) R⁴、- C (= W²) W³ R⁵、- S (= O)₂ R⁶、- P

($=W^4$) $R^7 R^8$ または $-C(=W^5)NR^9R^{10}$ であり；ならびに

各 G^A は、独立して、フェニル環または 5 員もしくは 6 員芳香族複素環であって、各環は、 R^u から独立して選択される 5 個以下の置換基で任意により置換されている。

【0166】

また、注目すべきは、実施形態 1 ~ 98 および A1 ~ A8 を含む上記の実施形態であって、ここで、式 1 は、その N - オキシドを含まず、その塩を含まず、または、その N - オキシドおよび塩を含まない。

【0167】

本発明はまた、植生の部位に除草的に有効な量の本発明の化合物を（例えば、本明細書に記載組成物として）適用する構成を含む、望ましくない植生を防除する方法に関する。使用方法に関連する実施形態として、上述の実施形態の化合物が関与するものに注目すべきである。また、上述の実施形態の化合物を含む本発明の除草組成物が実施形態として注目に値する。

10

【0168】

スキーム 1 ~ 12 に記載されている以下の方法および変形の 1 つ以上を用いて、式 1 の化合物を調製することが可能である。以下の式 1 ~ 17 の化合物における R^1 、 R^2 、 R^3 、 W^1 、G および J の定義は、特に記載のない限り、発明の概要において上記に定義されているとおりである。式 1a ~ 1b および式 3a ~ 3d は、それぞれ、式 1 ~ 3 の種々のサブセットである。

【0169】

20

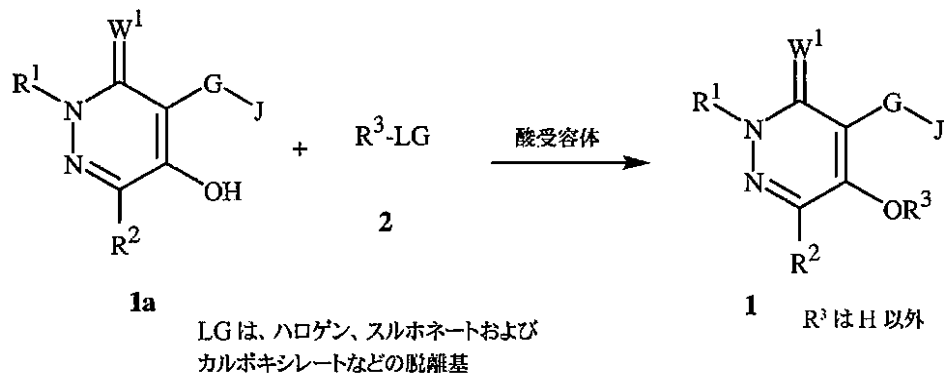
スキーム 1 において示されているとおり、式 1 の化合物（式中、 R^3 は H 以外）は、式 1a の化合物（ R^3 が H である式 1）と、式 2 のアシル化、スルホニル化またはリン酸化剤との酸受容体の存在下での反応により調製されることが可能である。この反応に好適な酸受容体としては、アルカリまたはアルカリ土類金属（例えば、リチウム、ナトリウム、カリウムおよびセシウム）水和物、アルコキシド、炭酸塩、リン酸塩および水酸化物などの無機塩基、ならびに、トリエチルアミン、N, N - ジイソプロピルエチルアミンおよび 1, 8 - ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エンなどの有機塩基が挙げられる。好ましい酸受容体は、トリアルキルアミンおよび水酸化カリウムである。広く多様な溶剤がこの反応に好適であって、例えばこれらに限定されないが、テトラヒドロフラン、ジクロロメタン、N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセタミド、N - メチルピロリジノン、アセトニトリルおよびアセトン、ならびに、これらの溶剤の混合物が挙げられる。LG がハロゲン、スルホネートおよびカルボキシレートなどの脱離基である、式 2 の化合物の典型的な例としては、カルボン酸ハロゲン化物、カルボン酸無水物、クロロホルメート、ハロゲン化カルバモイル、ハロゲン化スルホニル、スルホニル無水物、ハロゲン化スルファモイル、ハロリン酸塩およびハロホスホン酸塩が挙げられ、これは、技術分野において周知である方法によって調製されることが可能である。多くは市販されている。この反応は、約 -20 ~ 200、および、より典型的には、約 0 ~ 50 で実施されることが可能である。

30

【0170】

【化 8】

スキーム 1



10

【0171】

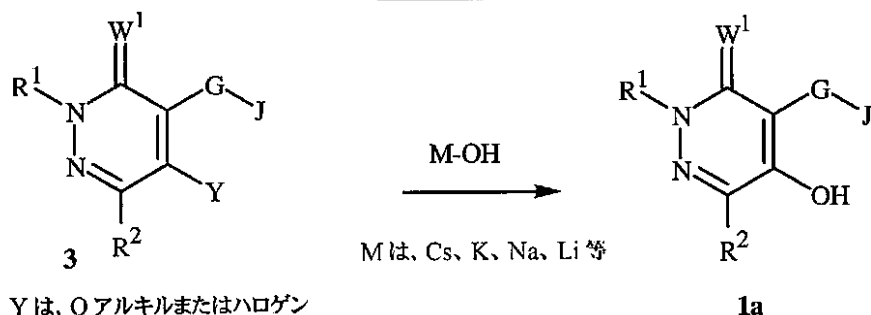
スキーム 2 において示されているとおり、式 1 a の化合物（ R^3 が H である式 1）は、式 3 の化合物と、アルカリまたはアルカリ土類金属（例えば、リチウム、ナトリウム、カリウムおよびセシウム）水酸化物との反応により調製されることが可能である。この反応は、典型的には、有機溶剤中、または、水と、エタノールあるいは他の低級アルキルアルコール、テトラヒドロフラン、ジオキサン、1, 2 - ジメトキシエタンおよび N, N - ジメチルホルムアミドなどの有機溶剤との混合物中に実施される。この反応は、0 ~ 150、および、好ましくは 50 ~ 120 の範囲の温度で実施されることが可能である。水酸化物は、一般に、式 3 の化合物に対して 1.5 ~ 40 倍の範囲で存在する。

20

【0172】

【化 9】

スキーム 2



30

【0173】

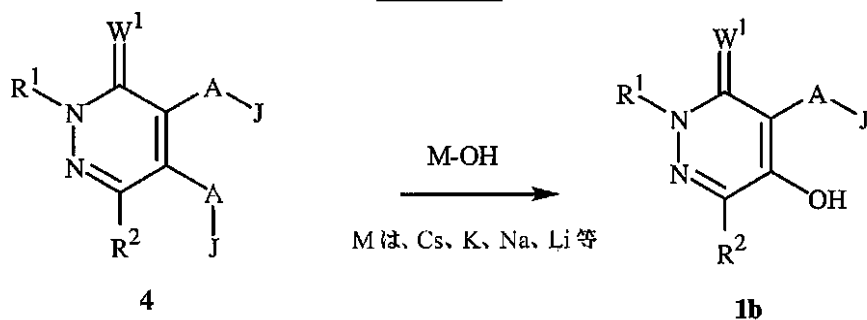
スキーム 3 において示されているとおり、式 1 b の化合物（式中、A が、N を介してピリダジノン環に結合されている、ピラゾール、イミダゾール、ピロールおよびトリアゾールなどのアゾールである）は、式 4 の化合物と、アルカリまたはアルカリ土類金属（例えば、リチウム、ナトリウム、カリウムおよびセシウム）水酸化物との反応により形成されることが可能である。この反応は、典型的には、有機溶剤中、または、水とエタノールおよび他の低級アルキルアルコール、テトラヒドロフラン、ジオキサン、1, 2 - ジメトキシエタンおよび N, N - ジメチルホルムアミドなどの有機溶剤との混合物中に実施される。この反応は、0 ~ 150、より典型的には 50 ~ 120 の範囲の温度で実施されることが可能である。水酸化物は、一般に、式 4 の化合物に対して 1.5 ~ 40 倍の範囲の過剰量で存在する。

40

【0174】

【化 1 0】

スキーム 3



10

【0 1 7 5】

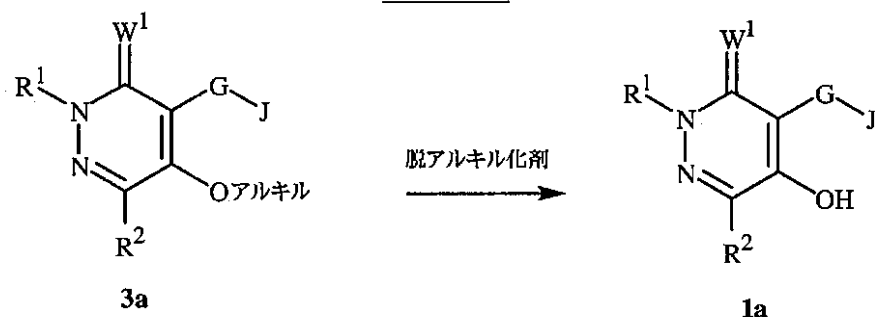
スキーム 4 は、式 3 a の化合物（Y が O アルキルである式 3）の脱アルキル化による式 1 a の化合物の合成を示す。エーテルを脱アルキル化する（式 3 a の化合物など）、三塩化アルミニウム、臭化水素、ヨードトリメチルシランおよび三臭化ホウ素を含む多くの脱アルキル化試薬が技術分野において公知である。三臭化ホウ素が、脱アルキル化のために好ましい。式 3 a のアルコキシ化合物は、塩素化炭化水素（例えば、ジクロロメタンおよびクロロホルム）などの溶剤中で、三臭化ホウ素で処理される。この反応は、典型的には、0 ~ 30 で実施されるが、約 50 ~ 120 の間などのより高い温度でも実施されることが可能である。脱アルキル化のための他の条件および試薬は、Larock、「Comprehensive Organic Transformations」、VCH Publishing、New York、1989 年、501 ~ 504 ページによって記載されている。

20

【0 1 7 6】

【化 1 1】

スキーム 4



30

【0 1 7 7】

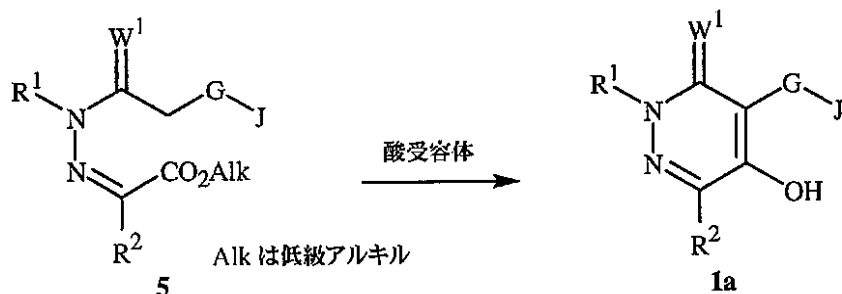
スキーム 5 は、式 5 のヒドラゾノエステルの、酸受容体の存在下での環化による式 1 a の化合物の合成を示す。この反応のための好適な酸受容体としては、アルカリまたはアルカリ土類金属（例えば、リチウム、ナトリウム、カリウムおよびセシウム）水和物などの無機塩基、ならびに、アルコキシドまたはトリエチルアミン、N, N - ジイソプロピルエチルアミンおよび 1, 8 - ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エンなどの有機塩基が挙げられる。広く多様な溶剤がこの反応に好適であって、例えば、特にこれらに限定されないが、芳香族炭化水素（例えば、トルエンおよびキシレン）、テトラヒドロフラン、ジオキサン、1, 2 - ジメトキシエタン、N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセタミド、N - メチルピロリジノン、およびアセトニトリル、ならびに、これらの溶剤の混合物が挙げられる。この反応は、約 - 20 ~ 200、より典型的には約 20 ~ 120 で実施されることが可能である。

40

【0 1 7 8】

【化 1 2】

スキーム 5



10

【0179】

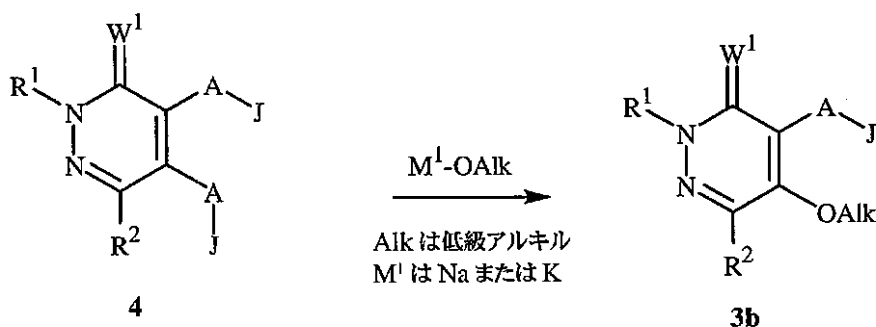
スキーム 6 において示されているとおり、式 3 b の化合物（式中、A は、N を介してピリダジノン環に結合しているピラゾール、イミダゾール、ピロールおよびトリアゾールなどのアゾール環である）は、式 4 の化合物をアルコールと、酸受容体の存在下に反応させることにより調製されることが可能である。この反応は、典型的には、酸受容体の存在下に、溶剤または共溶剤としてアルコール中で実施される。この反応のための好適な酸受容体としては、アルカリまたはアルカリ土類金属（例えば、リチウム、ナトリウム、カリウムおよびセシウム）水和物などの無機塩基、ならびに、アルコキシドまたはトリエチルアミン、N, N - ジイソプロピルエチルアミンおよび 1, 8 - ジアザビスクロ[5.4.0]

20

【0180】

【化 1 3】

スキーム 6



30

【0181】

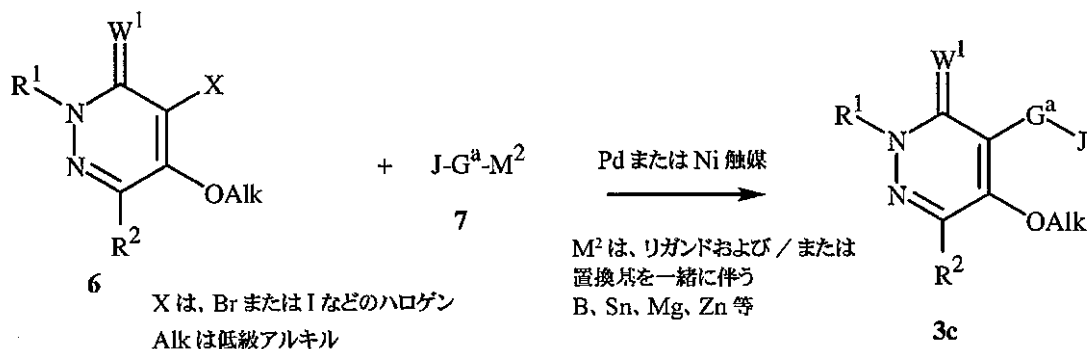
式 6 のハロピリダジノンと式 7 に示されている有機金属種との遷移金属触媒反応による、G^a が C を介してピリダジノン環に結合しているフェニル基または複素環である式 3 c の化合物の合成が、スキーム 7 に示されている。多様な金属、触媒およびリガンドが、このプロセスにおいて用いられることが可能である。この反応における使用に好適な式 7 の有機金属複素環の合成に関しては、Li および Gribble、*「Palladium in Heterocyclic Chemistry」*、第 1 版、Pergamon Press、Amsterdam、2000 年および第 2 版、Elsevier、Amsterdam、2007 年を参照のこと。この本はまた、スキーム 7 に記載されているクロスカップリング反応を実施するために好適な広く多様な触媒および反応条件を記載している。

40

【0182】

【化 1 4】

スキーム 7



10

【0183】

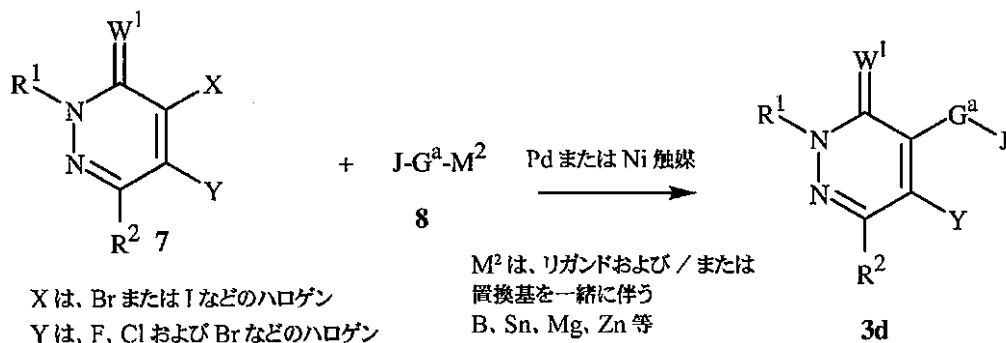
異なって置換されている（式 7 の X および Y が異なるハロゲンである）式 7 のハロピリダジノンと、式 8 により表される有機金属種との遷移金属触媒反応による、 G^a が C を介してピリダジノン環に結合しているフェニル基または複素環である式 3 d の化合物の合成がスキーム 8 に示されている。多様な金属、触媒およびリガンドがこのプロセスにおいて用いられ得る。環上の異なって置換されているハロゲンとの式 7 のピリダジノンの合成は、T. M. Stevenson ら、J. Heterocyclic Chem., 2005 年、42、427 ~ 435 ページおよび Zhang ら、Tetrahedron Lett., 2006 年、47、8733 ~ 8735 ページに見出されることが可能である。ピリダジノンに対する位置選択性のパラジウム触媒クロスカップリング反応に対する代替的なアプローチは、米国特許第 6,307,047 号明細書に見出される。

20

【0184】

【化 1 5】

スキーム 8



30

【0185】

あるいは、 G^a が C を介してピリダジノン環に結合しているフェニル基または複素環である式 3 c の化合物は、スキーム 9 に示されているとおり式 9 のピリダジノンの有機金属誘導体から形成されることが可能である。もっとも好ましい式 9 の有機金属試薬は、ヘキサメチルニスズなどのパイメタル試薬と、式 6 のハロピリダジノン化合物との、パラジウム触媒作用下での反応により形成される。得られる式 9 の錫化合物は、式 10 のハロ複素環とのパラジウム触媒カップリング反応によって、式 3 c の化合物に形質転換されることが可能である。錫ピリダジノンと芳香族および芳香族複素環式ハロゲン化物の反応についての条件および触媒、ならびに、式 9 の化合物の合成についての条件は、T. M. Stevenson ら、J. Heterocyclic Chem., 2005 年、42、427 ~ 435 ページに記載されている。ビス-（ピナコラト）ジボロンなどの他の試薬もまたこの合成に用いられることが可能である。

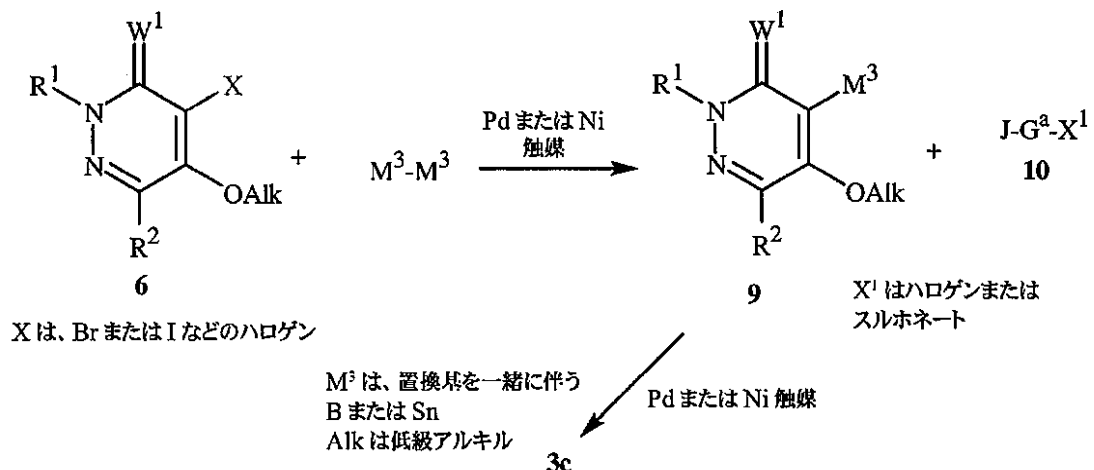
40

50

【 0 1 8 6 】

【 化 1 6 】

スキーム 9



10

【 0 1 8 7 】

式 5 の化合物は、スキーム 10 に示されているとおり、式 12 の活性化された酸誘導体および式 11 のヒドラゾンの、酸受容体の存在下での反応により合成されることが可能である。この反応のための好適な酸受容体としては、アルカリまたはアルカリ土類金属（例えば、リチウム、ナトリウム、カリウムおよびセシウム）水和物、アルコキシド、炭酸塩、リン酸塩および水酸化物などの無機塩基、ならびに、トリエチルアミン、N, N - ジイソプロピルエチルアミンおよび 1, 8 - ジアザビシクロ [5 . 4 . 0] ウンデカ - 7 - エンなどの有機塩基が挙げられる。特に有用な酸受容体は、トリアルキルアミンおよび水酸化カリウムである。広く多様な溶剤がこの反応のために好適であり、例えば特にこれらに限定されないが、テトラヒドロフラン、ジクロロメタン、N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセタミド、N - メチルピロリジノン、アセトニトリルおよびアセトン、ならびに、これらの溶剤の混合物が挙げられる。この反応は、約 - 20 ~ 100、より典型的には約 0 ~ 50 で実施されることが可能である。活性化された酸誘導体としては、例えば特にこれらに限定されないが、酸塩化物、酸臭化物、アシルイミダゾール、混合無水物およびアシルシアニドが挙げられる。

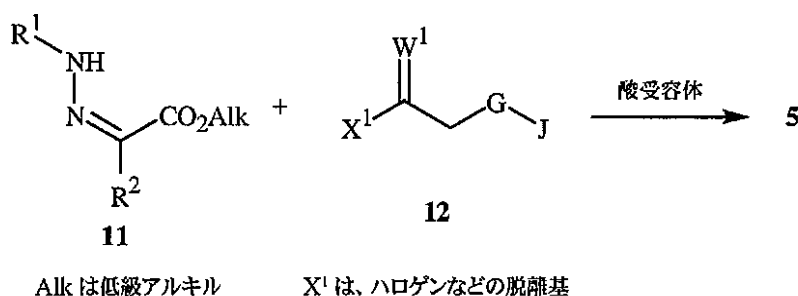
20

30

【 0 1 8 8 】

【 化 1 7 】

スキーム 10



40

【 0 1 8 9 】

式 11 のヒドラゾンは、Li ら、Synthesis、2007 年、3301 ~ 3308 ページおよびこの中で引用されている文献において記載されているとおり合成されることが可能である。ヒドラゾン中間体合成およびその環化のための手法が、米国特許出願公開第 2008 / 0090814 号明細書、Bioorg. Med. Chem. Lett.、2008 年、1413、Bioorg. Med. Chem. Lett.、2008 年、

50

1419、Bioorg. Med. Chem. Lett.、2008年、3421、Bioorg. Med. Chem. Lett.、2008年、4628、Bioorg. Med. Chem. Lett.、2008年、3446、Synthesis、2008年、610～616ページ、および、Tet. Lett.、2008年、49、811ページに見出される。

【0190】

式4の化合物(式中、Aは、Nを介してピリダジノン環に結合しているピラゾール、イミダゾール、ピロールおよびトリアゾールなどのアゾール環である)は、スキーム11に示されているとおり、式14の対応するアゾールと式13のジハロピリダジノンとの、酸受容体の存在下での反応によって形成されることが可能である。この反応のための好適な酸受容体としては、アルカリまたはアルカリ土類金属(例えば、リチウム、ナトリウム、カリウムおよびセシウム)水和物、アルコキシド、炭酸塩、リン酸塩および水酸化物などの無機塩基が挙げられる。多様な溶剤がこの反応のために好適であり、例えば、特にこれらに限定されないが、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセタミド、N-メチルピロリジノン、アセトニトリルおよびアセトンが挙げられる。特に有用な反応条件は、酸受容体としての炭酸カリウムおよび溶剤としてのN,N-ジメチルアセタミドの80～180の温度での使用を含む。完全に転換させるために、酸受容体および式14のアゾールは、式13の化合物に比して少なくとも2のモル比で充填される。

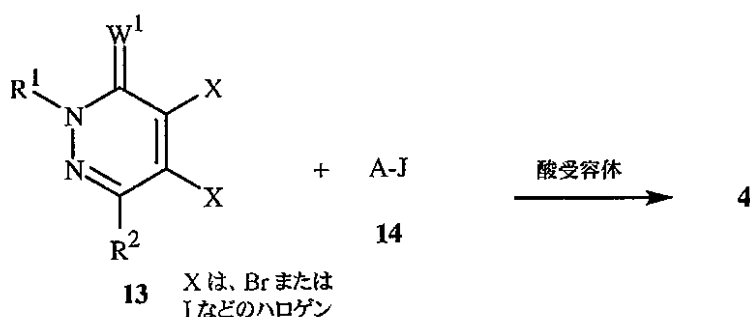
10

【0191】

【化18】

20

スキーム11



30

【0192】

式6および13のピリダジノンは、T. M. Stevensonら、J. Heterocyclic Chem.、2005年、42、427～435ページおよびこの中で引用されている文献に記載されているとおり調製されることが可能である。他のピリダジノンは、米国特許第2,782,195号明細書、ならびに、MaesおよびLemiere、Katritsky編、Comprehensive Heterocyclic Chemistry III、第8巻、1～117ページ; Elsevier、Oxfordに見出される。式14のアゾールは、米国特許第7,230,116号明細書およびこの中で引用されている文献において開示されている化学を用いて調製されることが可能である。

40

【0193】

スキーム12に示されているとおり、式5の化合物は、2ステップ経路により調製されることが可能である。第1のステップにおいて、式16の化合物は、式12の活性化された酸を式15の置換ヒドラジンで、酸受容体の存在下に縮合させて、式16のヒドラジドをもたらすことにより調製されることが可能である。この反応のための好適な酸受容体としては、アルカリまたはアルカリ土類金属(例えば、リチウム、ナトリウム、カリウムおよびセシウム)炭酸塩、リン酸塩および水酸化物などの無機塩基、ならびに、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミンおよび1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エンなどの有機塩基が挙げられる。特に有用な酸受容体はトリアルキ

50

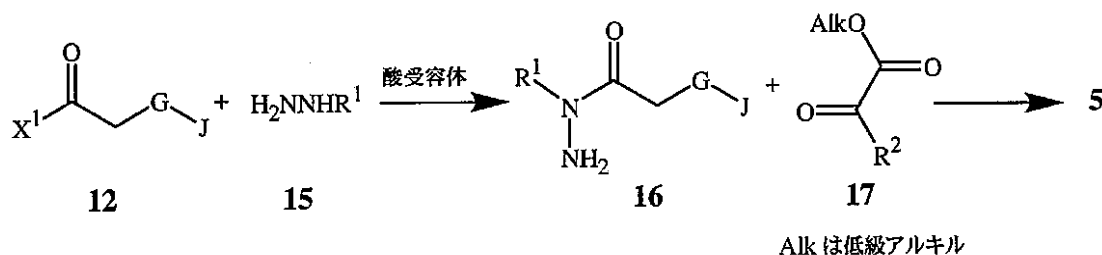
ルアミンおよび水酸化カリウムである。広く多様な溶剤がこの反応のために好適であり、例えば特にこれらに限定されないが、テトラヒドロフラン、ジクロロメタン、N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセタミド、N - メチルピロリジノン、アセトニトリルおよびアセトン、ならびに、これらの溶剤の混合物が挙げられる。この反応は、約 - 20 ~ 100、より典型的には約 0 ~ 50 で実施されることが可能である。式 12 の化合物としては、例えば特にこれらに限定されないが、酸塩化物、酸臭化物、アシルイミダゾール、混合無水物およびアシルシアニドが挙げられる。式 17 のケトエステルでの式 16 の化合物のさらなる処理は式 5 の化合物をもたらす。広く多様な溶剤がこの反応のために好適であり、例えば特にこれらに限定されないが、低級脂肪族アルコール、テトラヒドロフラン、ジクロロメタン、ジオキサン、クロロホルム、N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセタミド、N - メチルピロリジノン、アセトニトリルおよびアセトン、ならびに、これらの溶剤の混合物が挙げられる。この反応はまた、溶剤の不在下でも実施されることが可能である。この反応は、約 - 20 ~ 200、より典型的には約 0 ~ 100 で実施されることが可能である。

10

【0194】

【化19】

スキーム12



20

【0195】

式 12 の化合物に対する酸前駆体は、米国特許第 6, 767, 864 号明細書および米国特許第 7, 230, 116 号明細書および国際公開第 2007/014290 号パンフレット、国際公開第 2005/005428 号パンフレットおよび国際公開第 2007/119434 号パンフレットに記載の方法を用いて調製されることが可能である。

30

【0196】

式 1 の化合物を調製するための上述のいくつかの試薬および反応条件は、中間体中に存在する一定の官能基と適合性でなくともよいことが認知されている。これらの場合において、保護/脱保護シーケンスまたは官能基相互変換の合成への組み込みは、所望の生成物の入手を補助するであろう。保護基の使用および選択は、化学合成における当業者には明らかであろう（例えば、Greene, T. W.; Wuts, P. G. M., *Protective Groups in Organic Synthesis*, 第 2 版; Wiley: New York, 1991 年を参照のこと）。当業者は、いくつかの場合において、いずれかの別のスキームに示されている所与の試薬の導入の後、式 1 の化合物の合成を完了するために、詳細には記載されていない追加のルーチン合成ステップを実施する必要があり得ることを認知するであろう。当業者はまた、上記スキームに例示したステップの組み合わせを、式 1 の化合物の調製のために提示した特定のシーケンスにより示唆されるものの意外の順番で実施する必要があり得ることを認知するであろう。

40

【0197】

当業者は、本明細書に記載の式 1 の化合物および中間体は、種々の求電子性、求核性、ラジカル、有機金属、酸化、および還元反応に供されて、置換基が付加され、または、既存の置換基が変更されることが可能であることも認識するであろう。

【0198】

さらなる詳細なしで、当業者は、上記の記載を用いて、本発明を最大限に利用すること

50

が可能であると考えられている。以下の実施例は、従って、単に例示的であり、開示を如何様にも制限しないと解釈されるべきである。以下の実施例におけるステップは全合成形質転換における各ステップのための手法を例示しており、各ステップについての出発材料は、その手法が他の実施例またはステップにおいて記載されている特定の調製法によって調製されたものである必要性はなくてもよい。割合は、クロマトグラフィ溶媒混合物について、または、他に明記されている場合を除き、重量基準である。クロマトグラフィ溶媒混合物に対する部および割合は、他に示されていない限りにおいて体積基準である。¹H NMRスペクトルは、400 MHzでテトラメチルシラン低磁場側にppmで報告されており；「s」は一重項を意味し、「m」は多重項を意味し、dは二重項を意味し、およびbsは幅広の一重項を意味する。融点に関して、「dec.」は「分解」を意味する。質量スペクトルは、大気圧化学イオン化(AP⁺)を用いる質量分光測定により観察された、H⁺(1の分子量)の分子への付加により形成された最高同位体存在度の親イオン(M+1)の分子量として報告されている。

【実施例】

【0199】

実施例 1

5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 4 - [5 - メチル - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 3 (2H) - ピリダジノン (化合物 1) の調製

ステップ A: 2 - メチル - 4 , 5 - ビス [5 - メチル - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 3 (2H) - ピリダジノンの調製

3 - メチル - 5 - (4 - トリフルオロメチルフェニル)ピラゾール (2 g、8.9 mmol; 米国特許第 7, 230, 116 号明細書に記載のとおり調製した) および 4, 5 - ジクロロ - 2 - メチル - (2H) - ピリダジノン (Aldrich、0.85 g、4.7 mmol) の N, N - ジメチルホルムアミド (15 mL) 中の溶液を炭酸カリウム (粉末、1.9 g、13.8 mmol) で処理した。反応混合物を 100 で 11 時間加熱し、次いで、氷水に注いだ。得られた固体をろ過すると共に水で洗浄した。固体をジクロロメタン (50 mL) 中に溶解させると共に、硫酸マグネシウムで乾燥させた。ろ過および蒸発後の残渣を、溶出液として 6 : 1 ~ 4 : 1 ヘキサン / 酢酸エチルの勾配を用いる 20 g シリカゲルカラムでのクロマトグラフィに供して、0.75 g の表題の化合物を黄色の油として得た。

¹H NMR (CDCl₃) 8.17 (s, 1H)、7.85 (m, 2H)、7.70 (m, 2H)、7.65 (m, 2H)、6.45 (s, 1H)、6.40 (s, 1H)、3.96 (s, 3H)、2.26 (s, 3H)、2.05 (s, 3H)。

【0200】

ステップ B: 5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - [5 - メチル - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 3 (2H) - ピリダジノンの調製

2 - メチル - 4 , 5 - ビス [5 - メチル - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 3 (2H) - ピリダジノン (すなわち、ステップ A の生成物) (0.74 g、1.3 mmol) のメタノール (20 mL) 中の溶液を、ナトリウムメトキシド (メタノール中の 4.5 N 溶液、0.8 mL、3.6 mmol) で処理した。反応混合物を還流に加熱して懸濁している固形分を溶解させ、次いで、25 で 6 時間攪拌した。得られた混合物を飽和水性塩化アンモニウム溶液 (20 mL) で急冷すると共に、酢酸エチル (30 mL) で希釈した。酢酸エチル層を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過および蒸発させた。残渣を、溶出液として 3 : 1 ~ 1 : 1 ヘキサン / 酢酸エチルの勾配を用いる 10 g シリカゲルカートリッジでのクロマトグラフィに供して、0.4 g の表題の化合物を、ジエチルエーテルの添加で固化した油として得た。

¹H NMR (CDCl₃) 7.90 (m, 2H)、7.85 (s, 1H)、7.63 (m, 2H)、6.57 (s, 1H)、3.83 (m, 6H)、2.25 (s, 3H)。

【0201】

ステップC：5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 4 - [5 - メチル - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 3 (2 H) - ピリダジノンの調製

5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - [5 - メチル - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 3 (2 H) - ピリダジノン (すなわち、ステップBの生成物) (0 . 2 5 g、0 . 6 9 m m o l) のジクロロメタン (5 m L) 中の溶液に、三臭化ホウ素の溶液 (ジクロロメタン中に 1 . 0 M 溶液、0 . 8 2 m L、0 . 8 2 m m o l) を添加した。反応混合物を室温で 2 時間攪拌し、次いで、1 N 水性水酸化ナトリウム溶液 (4 m L) で処理した。1 5 分間攪拌した後、反応混合物を 1 N 水性塩酸 (4 m L) で p H 4 に調節した。次いで、反応混合物を硫酸マグネシウムで乾燥させ、および

10

¹ H N M R (C D C l ₃) 7 . 8 9 (s , 3 H)、7 . 8 6 (m , 2 H)、7 . 6 8 (m , 2 H)、6 . 6 0 (s , 1 H)、3 . 8 1 (s , 3 H)、2 . 3 5 (s , 3 H)。

【 0 2 0 2 】

実施例 2

4 - [3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 3) の調製

ステップA：4 , 5 - ビス [3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 2 - メチル - 3 (2 H) - ピリダジノンの調製

20

3 - メチル - 5 - (4 - クロロフェニル) ピラゾール (2 . 6 g、1 3 . 5 m m o l ; 米国特許第 7 , 2 3 0 , 1 1 6 号明細書に記載のとおり調製した) および N - メチル - 4 , 5 - ジクロロピリダジノン (A l d r i c h、1 . 0 7 g、5 . 9 m m o l) の N , N - ジメチルアセタミド (1 0 m L) 中の溶液を炭酸カリウム (粉末、3 . 2 g、2 3 . 2 m m o l) で処理した。反応混合物を 1 2 0 ~ 1 3 0 で 4 時間加熱し、次いで、氷水に注いだ。分離した固体をろ過すると共に水で洗浄した。固体をジクロロメタン (5 0 m L) 中に溶解させると共に、硫酸マグネシウムで乾燥させた。溶液を減圧中でろ過および濃縮した。得られた残渣を、溶出液としてジクロロメタンを用いる 2 0 g シリカゲルカートリッジでのクロマトグラフィに供して、1 . 6 g の表題の化合物を黄色の固体として得た

30

¹ H N M R (C D C l ₃) 8 . 1 6 (s , 1 H)、7 . 6 5 (m , 2 H)、7 . 5 0 (m , 2 H)、7 . 3 5 (m , 2 H)、7 . 2 0 (m , 2 H)、6 . 4 0 (2 x s , 2 H)、3 . 9 4 (s , 3 H)、2 . 2 1 (s , 3 H)、1 . 9 8 (s , 3 H)。

【 0 2 0 3 】

ステップB：4 - [3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 (2 H) - ピリダジノンの調製

4 , 5 - ビス [3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 2 - メチル - 3 (2 H) - ピリダジノン (すなわち、ステップAの生成物) (1 . 3 5 g、2 . 7 m m o l) および水性水酸化ナトリウム (5 0 %、3 m L) を、メタノール (4 0 m L) と水 (1 0 m L) との混合物中に溶解させた。不均質な反応混合物を還流で 2 時間加熱したところ、この間に均質となった。反応混合物を減圧下で蒸発させ、残渣を 6 N 水性塩酸で酸性化した。得られたガムを分離し、水で洗浄し、次いで、熱酢酸エチル (1 5 0 m L) 中に溶解させた。反応溶液を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過および蒸発させた。得られた残渣を、溶出液として、ジクロロメタン、続いて、9 0 : 1 0 ~ 0 : 1 0 0 のジクロロメタン / 酢酸エチルの勾配混合物を用いる 2 0 g シリカゲルカートリッジでのクロマトグラフィに供して、本発明の化合物である 4 6 0 m g の表題の生成物をオフホワイトの固体として得た。

40

¹ H N M R (C D C l ₃) 7 . 7 7 (s , 1 H)、7 . 6 6 (m , 2 H)、7 . 4 0 (m , 2 H)、6 . 4 6 (s , 1 H)、3 . 8 0 (s , 3 H)、2 . 2 7 (s , 3 H)。

50

【0204】

実施例 3

5 - [3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 ,
6 - ジヒドロ - 1 - メチル - 6 - オキソ - 4 - ピリダジニル - 1 - メチルエチルカーボネ
ート (化合物 7) の調製

4 - [3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 5
- ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 (2 H) - ピリダジノン (すなわち、実施例 2、ステップ
B の生成物) (0 . 1 7 5 g、0 . 5 4 m m o l) のジクロロメタン (1 5 m L) の溶液
を、トリエチルアミン (0 . 6 m L、4 . 2 m m o l) で、続いて、イソプロピルクロロ
ホルメート (トルエン中の 1 M 溶液、1 . 0 m L、1 m m o l) で処理した。反応混合物
を 2 5 で 2 時間攪拌した。次いで、これを 1 N 水性塩酸 (1 0 m L) で急冷すると共に
、ジクロロメタン (1 0 m L) で希釈した。有機層を飽和水性重炭酸ナトリウム溶液 (2
0 m L) で洗浄した。有機層を分離し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、およぼろ過した。
得られた濾液を減圧下で蒸発させると共に、得られた残渣を、溶出液として 1 - クロロブ
タン (1 0 0 %) ~ 1 - クロロブタン / 酢酸エチル (9 0 : 1 0) の勾配を用いる 1 0 g
シリカゲルカートリッジでのクロマトグラフィに供して、本発明の化合物である、2 0 0
m g の表題の生成物をオフホワイトの固体として得た。

¹ H N M R (C D C l ₃) 7 . 8 9 (s , 1 H)、7 . 6 9 (m , 2 H)、7 . 3 5
(m , 2 H)、6 . 4 5 (s , 1 H)、4 . 7 5 (m , 1 H)、3 . 8 8 (s , 3 H)、
2 . 3 3 (s , 3 H)、1 . 1 2 (m , 6 H)。

【0205】

実施例 4

4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 4 - チアゾリル] - 5 - ヒドロキシ -
2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 7 9) の調製

ステップ A 2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 4 - チアゾール酢酸 2 - (2 -
エトキシ - 1 - メチル - 2 - オキソエチリジン) - 1 - メチルヒドラジドの調製

2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチルチアゾール - 4 - 酢酸 (1 . 2 g、4 . 2 m
m o l) のジクロロメタン (1 0 m L) 中の 2 3 の懸濁液を、メタンスルホニルクロリ
ド (0 . 3 5 m L) で処理した。紫色がかった混合物を 1 0 分攪拌し、次いで、メチルヒ
ドラジン (0 . 3 5 g) で処理した。3 0 分攪拌下後、混合物を酢酸エチル (4 0 m L)
および飽和水性重炭酸ナトリウム溶液 (3 0 m L) で処理した。有機層を硫酸マグネシウ
ムで乾燥させると共に、フォームに濃縮した。残渣をエタノール (1 5 m L) 中に懸濁さ
せ、エチルピルビン酸 (0 . 3 5 g、3 . 0 m m o l) で処理すると共に、還流に加熱し
た。3 0 分後、溶剤を蒸発させ、残渣を酢酸エチル / ヘキサン (6 : 1 ~ 3 : 1) の勾配
を用いるシリカゲルクロマトグラフィ (2 0 g シリカ) に供した。適切な画分を組み合わ
せると共に、蒸発させて、少量の酢酸エチルと一緒に表題の化合物を含有する 0 . 5 3 g
の濃い油を得た。

【0206】

ステップ B 4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 4 - チアゾリル] - 5 -
ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノンの調製

2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 4 - チアゾール酢酸 2 - (2 - エトキシ -
1 - メチル - 2 - オキソエチリジン) - 1 - メチルヒドラジド (すなわち、ステップ A の
生成物) (0 . 5 2 g) のテトラヒドロフラン (1 5 m L) 中の 2 3 の溶液を、カリウ
ム t - ブトキシド (T H F 中の 1 M、4 m L) で滴下して処理した。赤色の混合物を 3 0
分攪拌し、次いで、塩酸 (1 N、2 0 m L) で急冷した。この混合物を酢酸エチル (2 x
5 0 m L) で抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥させると共に、蒸発させた。残渣を、ジク
ロロメタン / 酢酸エチル (1 0 0 : 1 ~ 2 0 : 1 ~ 1 0 : 1) の勾配を用いるシリカゲル
クロマトグラフィ (2 0 g シリカ) に供し、適切な画分を組み合わせると共に、蒸発させ
て、本発明の化合物である 7 0 m g の表題の生成物を得た。

¹ H N M R (C D C l ₃) 7 . 7 9 (m , 2 H)、7 . 4 3 (m , 2 H)、3 . 7 8

(s, 3H)、2.66 (s, 3H)、2.35 (s, 3H)。

【0207】

実施例 5

5 - ヒドロキシ - 2, 6 - ジメチル - 4 - [5 - メチル - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 3 (2H) - ピリダジノンの調製

ステップ A 6 - ブロモ - 4, 5 - ジクロロ - 3 (2H) - ピリダジノンの調製

4, 5 - ジクロロピリダジノン (5.0 g、30 mmol) および水 (30 mL) の混合物を、臭素 (1.9 mL、36 mmol) で、180 で 30 分、高周波レンジ中に処理した。冷却してから、混合物を水 (50 mL) で希釈し、および、固体をろ過により回収し、水 (10 mL) で洗浄して、乾燥させた後に、オフホワイトの固体 (6.75 g) として表題の化合物を得た。

【0208】

ステップ B 6 - ブロモ - 4, 5 - ジクロロ - 2 - メチル - 3 (2H) - ピリダジノンの調製

6 - ブロモ - 4, 5 - ジクロロ - 3 (2H) - ピリダジノン (すなわち、ステップ A の生成物) (6.6 g、27 mmol) を N, N - ジメチルホルムアミド (30 mL) 中に溶解させると共に、炭酸カリウム (11 g、81 mmol) およびヨードメタン (1.7 mL、27 mmol) で処理した。この混合物を 18 時間、23 で攪拌し、水 (50 mL) で希釈すると共に、酢酸エチル (3 x 20 mL) で抽出した。組み合わせた抽出物を塩水 (50 mL) で洗浄すると共に、硫酸マグネシウムで乾燥させた。濃縮させた後、残渣を、酢酸エチル / ヘキサン (0 : 100 ~ 100 : 0) の勾配を用いるシリカゲルクロマトグラフィ (40 g シリカ) に供し、適切な画分を組み合わせると共に、蒸発させて、4.88 g の表題の化合物を得た。

¹H NMR (CDCl₃) 3.82 (s, 3H)。

【0209】

ステップ C 4, 5 - ジクロロ - 2, 6 - ジメチル - 3 (2H) - ピリダジノンの調製

6 - ブロモ - 4, 5 - ジクロロ - 2 - メチル - 3 (2H) - ピリダジノン (すなわち、ステップ B の生成物) (3.3 g、13 mmol)、ジクロロ [1, 1' - ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン] パラジウム (II) ジクロロメタン付加物 (1 : 1) (PdCl₂ (dppf) としても知られている) (0.94 g、1.3 mmol)、炭酸セシウム (6.9 g、21 mmol) およびトリメチルボロキシン (1.3 mL、9.3 mmol) をジオキサン (30 mL) と組み合わせると共に、還流で 18 時間加熱した。追加のトリメチルボロキシン (1.0 mL) を添加し、還流をさらに 4 時間継続させた。この混合物を水 (20 mL)、飽和水性エチレンジアミン四酢酸ナトリウム塩溶液 (40 mL) およびジクロロメタン (40 mL) で希釈した。水性層をジクロロメタン (2 x 20 mL) で抽出し、組み合わせた有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた。蒸発させた後の残渣を、酢酸エチル / ヘキサン (0 : 100 ~ 100 : 0) の勾配を用いるシリカゲルクロマトグラフィ (40 g シリカ) に供し、適切な画分を組み合わせると共に、蒸発させて、1.7 g の表題の化合物を白色の固体として得た。

¹H NMR (CDCl₃) 3.82 (s, 3H)、2.43 (s, 3H)。

【0210】

ステップ D 5 - メトキシ - 2, 6 - ジメチル - 4 - [5 - メチル - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 3 (2H) - ピリダジノンの調製

4, 5 - ジクロロ - 2, 6 - ジメチル - 3 (2H) - ピリダジノン (すなわち、ステップ C の生成物) (0.62 g、3.2 mmol)、炭酸カリウム (2.9 g、21 mmol) および 3 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 5 - メチルピラゾール (1.46 g、6.4 mmol) を N, N - ジメチルアセタミド (10 mL) と混合すると共に、140 で 3 時間加熱した。次いで、混合物を氷水 (100 mL) に注ぎ入れ、ジクロロメ

タン (3 × 2 0 m L) で抽出し、茶色の油 (1 . 3 3 g) に濃縮し、これをメタノール (2 0 m L) 中に溶解させると共に、ナトリウムメトキシド溶液 (メタノール中に 2 5 % 、 2 . 5 m L 、 1 1 m m o l) で処理した。濃色の混合物を還流で 3 . 5 時間加熱した。次いで、混合物を水性塩酸 (3 0 m L) で希釈すると共に、酢酸エチル (3 × 3 0 m L) で抽出した。組み合わせた抽出物を塩水 (2 0 m L) で洗浄すると共に、硫酸マグネシウムで乾燥させた。蒸発させた後の残渣を、酢酸エチル / ヘキサン (0 : 1 0 0 ~ 1 0 0 : 0) の勾配を用いるシリカゲルクロマトグラフィ (4 0 g シリカ) に供し、適切な画分を組み合わせると共に、蒸発させて、0 . 3 5 g の表題の化合物を得た。

¹ H NMR (C D C l ₃) 7 . 9 1 (m , 2 H) 、 7 . 6 3 (m , 2 H) 、 6 . 5 8 (s , 1 H) 、 3 . 7 4 (s , 3 H) 、 3 . 5 2 (s , 3 H) 、 2 . 3 0 (s , 6 H) 。

【 0 2 1 1 】

ステップ E 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 4 - [5 - メチル - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 3 (2 H) - ピリダジノンの調製

5 - メトキシ - 2 , 6 - ジメチル - 4 - [5 - メチル - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 3 (2 H) - ピリダジノン (すなわち、ステップ D の生成物) (0 . 3 5 g 、 0 . 9 m m o l) をジオキサン (2 0 m L) 中に溶解すると共に、水性水酸化ナトリウム溶液 (5 0 % 、 1 0 m L 、 過剰量) で処理した。混合物を還流で 1 8 時間加熱した。次いで、混合物を水で希釈すると共に、酢酸エチル (3 0 m L) で抽出した。水性層を水性 6 N 塩酸で酸性化すると共に、酢酸エチル (2 × 3 0 m L) で抽出した。酸性化後の抽出からの組み合わせた有機抽出物を硫酸マグネシウムで乾燥させ、蒸発させて、本発明の化合物である、0 . 1 2 g の表題の化合物を 1 9 1 ~ 1 9 4 で溶融する固体として得た。

¹ H NMR (C D C l ₃) 7 . 8 7 (m , 2 H) 、 7 . 6 7 (m , 2 H) 、 6 . 5 8 (s , 1 H) 、 3 . 7 9 (s , 3 H) 、 2 . 4 0 (s , 3 H) 、 2 . 3 6 (s , 3 H) 。

【 0 2 1 2 】

実施例 6

4 - [4 - ブロモ - 1 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 8 7) の調製

ステップ A 3 - ヨード - 1 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - ピラゾールの調製

3 - ヨードピラゾール (国際公開第 2 0 0 7 / 0 3 5 3 0 9 号パンフレットに記載のとおり調製した) (1 . 0 g 、 5 . 1 m m o l) 、 4 - フルオロベンゾトリフロリド (0 . 7 2 m L 、 5 . 7 m m o l) および炭酸カリウム (0 . 9 3 g 、 6 . 7 m m o l) の混合物を、N , N - ジメチルホルムアミド (1 0 m L) 中に 1 0 0 で 2 時間攪拌した。この混合物を水 (6 0 m L) で希釈すると共に、酢酸エチル (2 × 3 0 m L) で抽出した。有機層を組み合わせ、硫酸マグネシウムで乾燥させると共に濃縮した。蒸発させた後の残渣を酢酸エチル / クロロブタン (0 : 1 0 0 ~ 5 0 : 5 0) の勾配を用いるシリカゲルクロマトグラフィ (4 0 g シリカ) に供し、適切な画分を組み合わせると共に、蒸発させて、表題の化合物 (1 . 2 7 g) を得た。

¹ H NMR (C D C l ₃) 7 . 7 9 (m , 3 H) 、 7 . 7 1 (m , 2 H) 、 6 . 6 7 (d , 1 H) 。

【 0 2 1 3 】

ステップ B 5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - [1 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 3 (2 H) - ピリダジノンの調製

3 - ヨード - 1 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - ピラゾール (すなわち、ステップ A の生成物) (1 . 3 g 、 2 . 6 m m o l) 、 5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - トリメチルスタニル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン (J . H e t e r o c y c l i c C h e m . 、 2 0 0 5 年、4 2、4 2 7 に記載のとおり調製した) (0 . 9 5 g 、 3

10

20

30

40

50

・ 1 mmol)、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリド(0.36 g、0.52 mmol)およびヨウ化銅(I)(50 mg、0.26 mmol)をジオキサン(15 mL)中で混合すると共に、還流で2時間加熱した。この反応混合物をCelite(登録商標)珪藻土ろ過助剤を通してろ過し、Celite(登録商標)を酢酸エチル(20 mL)で洗浄した。有機物を蒸発させ、残渣を、酢酸エチル/ヘキサン(0:100~80:20)の勾配を用いるシリカゲルクロマトグラフィ(40 gシリカ)に供した。適切な画分を組み合わせると共に、蒸発させて、表題の化合物(0.51 g)を固体として得た。

^1H NMR(CDCl₃) 8.04(m, 1H)、7.90(s, 1H)、7.88(m, 2H)、7.71(m, 2H)、7.13(m, 1H)、4.04(s, 3H)、3.84(s, 3H)。

10

【0214】

ステップC 4-[4-プロモ-1-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]-1H-ピラゾール-3-イル]-5-メトキシ-2-メチル-3(2H)-ピリダジノンの調製
5-メトキシ-2-メチル-4-[1-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]-1H-ピラゾール-3-イル]-3(2H)-ピリダジノン(すなわち、ステップBの生成物)(0.15 g、0.43 mmol)およびN-プロモスクシンイミド(0.076 g、0.43 mmol)をN,N-ジメチルホルムアミド(5 mL)中に溶解させると共に、80℃で4時間攪拌した。N-プロモスクシンイミド(30 mg)を添加し、加熱はさらに16時間継続した。次いで、反応混合物を水(40 mL)で希釈すると共に、酢酸エチル(3×20 mL)で抽出した。有機抽出物を硫酸マグネシウムで乾燥させると共に蒸発させた。残渣を、酢酸エチル/ヘキサン(0:100~80:20)の勾配を用いるシリカゲルクロマトグラフィ(12 gシリカ)に供した。適切な画分を組み合わせると共に、蒸発させて、白色の固体(0.13 g)として表題の化合物を得た。

20

^1H NMR(CDCl₃) 8.10(s, 1H)、7.87(s, 1H)、7.83~7.68(m, 4H)、3.94(s, 3H)、3.84(s, 3H)。

【0215】

ステップD 4-[4-プロモ-1-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]-1H-ピラゾール-3-イル]-5-ヒドロキシ-2-メチル-3(2H)-ピリダジノンの調製

30

4-[4-プロモ-1-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]-1H-ピラゾール-3-イル]-5-メトキシ-2-メチル-3(2H)-ピリダジノン(すなわち、ステップCの生成物)(0.13 g、0.31 mmol)を、ジオキサン(10 mL)、水性水酸化ナトリウム(50%、5 mL)およびメタノール(1 mL)と混合した。この反応混合物を90℃で16時間加熱した。次いで、反応混合物を水(20 mL)で希釈すると共に、酢酸エチル(15 mL)で抽出した。次いで、水性層を6 M塩酸で酸性化し、酢酸エチル(3×20 mL)で抽出した。酸性化後の抽出からの組み合わせた有機抽出物を硫酸マグネシウムで乾燥させると共に蒸発させた。残渣を、酢酸エチル/ヘキサン(20:80~100:0)の勾配を用いるシリカゲルクロマトグラフィ(12 gシリカ)に供し、適切な画分を組み合わせると共に、蒸発させて、237~241℃で溶融する固体(0.07 g)として、本発明の化合物である表題の生成物を得た。

40

^1H NMR(CDCl₃) 8.19(s, 1H)、7.80-7.73(m, 5H)、3.83(s, 3H)。

【0216】

実施例7

5-ヒドロキシ-2-メチル-4-[4-メチル-1-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]-1H-ピラゾール-3-イル]-3(2H)-ピリダジノン(化合物85)の調製

ステップA 3-ヨード-4-メチル-1H-ピラゾールの調製

4-メチルピラゾール(10.0 g、122 mmol)のN,N-ジメチルホルムアミ

50

ド (1 0 0 m L) 中の溶液を、23 で、N - ヨードスクシンイミド (2 7 . 4 g 、 1 2 m m o l) で 1 8 時間処理した。この反応混合物を水 (1 0 0 m L) で希釈し、次いで、ろ過した。濾液を酢酸エチル (3 × 5 0 m L) で抽出した。組み合わせた有機抽出物を塩水 (1 0 0 m L) で洗浄すると共に、硫酸マグネシウムで乾燥させた。蒸発させた後の残渣を酢酸エチル / ヘキサン (0 : 1 0 0 ~ 8 0 : 2 0) の勾配を用いるシリカゲルクロマトグラフィ (8 0 g シリカ) に供し、適切な画分を組み合わせると共に、蒸発させて、5 . 3 9 g の表題の化合物を固体として得た。

^1H NMR (CDCl_3) 7 . 3 5 (s , 1 H) 、 2 . 0 4 (s , 3 H) 。

【 0 2 1 7 】

ステップ B 3 - ヨード - 4 - メチル - 1 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - ピラゾールの調製

3 - ヨード - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール (すなわち、ステップ A の生成物) (0 . 5 0 g 、 2 . 4 m m o l) 、 4 - フルオロベンゾトリフロリド (0 . 3 4 m L 、 2 . 6 m m o l) および炭酸カリウム (0 . 4 3 g 、 3 . 1 m m o l) を、N , N - ジメチルホルムアミド (2 0 m L) と組み合わせると共に、100 で 2 時間加熱した。反応混合物を水 (5 0 m L) で希釈し、酢酸エチル (2 × 3 0 m L) で抽出した。有機層を組み合わせ、硫酸マグネシウムで乾燥させると共に濃縮した。蒸発させた後の残渣を、酢酸エチル / ヘキサン (0 : 1 0 0 ~ 8 0 : 2 0) の勾配を用いるシリカゲルクロマトグラフィ (1 2 g シリカ) に供し、適切な画分を組み合わせると共に、蒸発させて、表題の化合物 (0 . 3 2 g) を得た。

^1H NMR (CDCl_3) 7 . 7 5 (m , 2 H) 、 7 . 6 8 (m , 2 H) 、 7 . 6 1 (s , 1 H) 、 2 . 0 7 (s , 3 H) 。

【 0 2 1 8 】

ステップ C 5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - [4 - メチル - 1 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 3 (2 H) - ピリダジノンの調製

3 - ヨード - 4 - メチル - 1 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - ピラゾール (すなわち、ステップ B の生成物) (0 . 3 2 g 、 0 . 7 6 m m o l) 、 5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - トリメチルスタニル - 2 H - ピリダジン - 3 - オン (J . H e t e r o c y c l i c C h e m . 、 2 0 0 5 年、42、427 に記載のとおり調製した) (0 . 2 3 g 、 0 . 9 m m o l) 、ビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (I I) ジクロリド (0 . 1 0 g 、 0 . 1 5 m m o l) およびヨウ化銅 (1 0 m g 、 0 . 0 7 6 m m o l) をジオキサン (1 0 m L) 中で混合し、還流で 2 時間加熱した。この反応混合物を Cel l i t e (登録商標) を通してろ過し、Cel l i t e (登録商標) を酢酸エチル (2 0 m L) で洗浄した。濾液を蒸発させ、残渣を、酢酸エチル / クロロブタン (0 : 1 0 0 ~ 1 0 0 : 0) の勾配を用いるシリカゲルクロマトグラフィ (1 2 g シリカ) に供し、適切な画分を組み合わせると共に、蒸発させて、表題の化合物 (0 . 1 1 g) を固体として得た。

^1H NMR (CDCl_3) 7 . 8 5 (m , 2 H) 、 7 . 8 0 (m , 2 H) 、 7 . 6 8 (m , 2 H) 、 3 . 9 0 (s , 3 H) 、 3 . 8 2 (s , 3 H) 、 2 . 0 7 (s , 3 H) 。

【 0 2 1 9 】

ステップ D 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 4 - [4 - メチル - 1 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 3 (2 H) - ピリダジノンの調製

5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - [4 - メチル - 1 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 3 (2 H) - ピリダジノン (すなわち、ステップ C の生成物) (0 . 1 0 g 、 0 . 2 4 m m o l) を、ジオキサン (1 0 m L) 、水性水酸化ナトリウム (5 0 % 、 4 m L) およびメタノール (1 m L) と混合した。この混合物を 90 で 3 1 時間加熱した。反応を水 (2 0 m L) で希釈し、酢酸エチル (1 5 m L) で抽出した。水性層を塩酸で酸性化すると共に、酢酸エチル (3 × 2 0 m L) で抽出した。酸性化後の抽出からの組み合わせた有機抽出物を硫酸マグネシウムで乾燥させると共

10

20

30

40

50

に蒸発させた。残渣を、酢酸エチル／ヘキサン（20：80～100：0）の勾配を用いるシリカゲルクロマトグラフィ（12 gシリカ）に供し、適切な画分を組み合わせると共に、蒸発させて、本発明の化合物である表題の生成物を、150～154 で溶融する固体（0.09 g）として得た。

^1H NMR (CDCl₃) 7.91 (s, 1H)、7.75 (m, 5H)、3.81 (s, 3H)、2.38 (s, 3H)。

【0220】

実施例 8

4 - [1 - (4 - クロロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 30) の調製

ステップ A 5 - クロロ - 2 - メチル - 4 - (1 - プロピン - 1 - イル) - 3 (2 H) - ピリダジノンの調製

1 - メチル - 4 - ヨード - 5 - クロロ - 2 H - ピリダジン - 3 - オン (J . H e t e r o c y c l i c C h e m . , 2005 年、42、427 に記載のとおり調製した) (2 . 5 g、9 . 3 m m o l)、ビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (I I) ジクロリド (0 . 13 g) およびトリブチル (1 - プロピニル) 錫 (3 . 3 g、10 m m o l) のジオキサン (12 m L) 中の混合物を還流で3時間加熱した。蒸発させた後の残渣を、酢酸エチル／クロロブタン (0 : 100 ~ 10 : 90) の勾配を用いるシリカゲルクロマトグラフィ (20 g シリカ) に供し、適切な画分を組み合わせると共に、蒸発させ、次いで、ヘキサン／ジエチルエーテル (10 : 1) の混合物でトリチュレートして表題の化合物 (1 . 1 g) を固体として得た。

^1H NMR (CDCl₃) 7.71 (s, 1H)、3.76 (s, 3H)、2.22 (s, 3H)。

【0221】

ステップ B 4 - [1 - (4 - クロロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 (2 H) - ピリダジノンの調製

5 - クロロ - 2 - メチル - 4 - (1 - プロピン - 1 - イル) - 3 (2 H) - ピリダジノン (すなわち、ステップ A の生成物) (0 . 46 g、2 . 5 m m o l) および 4 - クロロフェニルシドノン (J . O r g . C h e m . , 1974 年、39、3676 ページに記載のとおり調製した) (0 . 50 g、2 . 5 m m o l) をメシチレン (5 m L) 中で混合し、140 で18時間加熱した。メシチレンを蒸散させ、残渣を、酢酸エチル／ジクロロメタン (5 : 95 ~ 30 : 70) の勾配を用いるシリカゲルクロマトグラフィ (20 g シリカ) に供し、適切な画分を組み合わせると共に、蒸発させて、クロロピリダジノン中間体 (0 . 10 g) を得た。この残渣を、ジオキサン (10 m L)、水性水酸化ナトリウム (50 %、4 m L) およびメタノール (1 m L) の混合物中に溶解させ、次いで、90 で31時間加熱した。反応混合物を水 (20 m L) で希釈すると共に、酢酸エチル (15 m L) で抽出した。次いで、水性層を塩酸で酸性化して固体を得、これをろ過により回収した。この固体を酢酸エチル (20 m L) 中に溶解させ、硫酸マグネシウムで乾燥させると共に蒸発させて、147 ~ 151 で溶融する本発明の化合物である、0.061 g の表題の生成物を得た。

^1H NMR (CDCl₃) 7.81 (s, 1H)、7.75 (s, 1H)、7.56 (m, 2H)、7.45 (m, 2H)、3.81 (s, 3H)、2.37 (s, 3H)。

【0222】

実施例 9

4 - [3 - (4 - ブロモフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 5 - ヒドロキシ - 2 - (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 77) の調製

ステップ A 4 , 5 - ビス [3 - (4 - ブロモフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 2 - (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) - 3 (2 H) - ピリダジノンの調製

4, 5 - ジクロロ - 2 - (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) - 3 (2 H) - ピリダジノン、(0.525 g、2.11 mmol; J. Heterocyclic Chem., 1995 年、32、1473 ~ 1476 に記載のとおり調製した) を、3 - (4 - プロモフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール (1.0 g、4.2 mmol) および炭酸カリウム (1.5 g、11 mmol) の N, N - ジメチルアセタミド (7 mL) 中の混合物に添加すると共に、140 °C に 16 時間加熱した。次いで、反応混合物を水で希釈すると共に、酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機抽出物を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、および、濃縮して、1.38 g の粗生成物を得、これを精製せずに用いた。

【0223】

ステップ B 4 - [3 - (4 - プロモフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 5 - メトキシ - 2 - (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) - 3 (2 H) - ピリダジノンの調製

ステップ A からの粗生成物 (すなわち、4, 5 - ビス [3 - (4 - プロモフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 2 - (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) - 3 (2 H) - ピリダジノン) (1.38 g、2.12 mmol) をメタノール (9 mL) 中に溶解させた溶液に、ナトリウムメトキシドのメタノール中の 1 mL の 25 % w/w 溶液を添加した。この混合物を還流で 1 時間加熱し、次いで、10 mL 1 N 塩酸で急冷した。混合物を酢酸エチルで抽出し、組み合わせた有機抽出物を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、および、濃縮した。粗残渣を、シリカゲルクロマトグラフィ (溶出液としてヘキサン中の酢酸エチルの 0 ~ 100 % 勾配) により精製して、0.31 g の表題の化合物を固体として得た。

¹H NMR (CDCl₃) 7.91 (s, 1H) 7.66 (d, 2H) 7.49 (m, 2H) 6.48 (s, 1H) 6.04 (d, 1H) 4.13 (m, 1H) 3.79 (s, 3H) 3.70 (m, 1H) 2.23 (s, 3H) 2.13 (m, 1H) 2.03 (bs, 1H) 1.67 (m, 4H)。

【0224】

ステップ C 4 - [3 - (4 - プロモフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 5 - ヒドロキシ - 2 - (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) - 3 (2 H) - ピリダジノン

4 - [3 - (4 - プロモフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 5 - メトキシ - 2 - (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) - 3 (2 H) - ピリダジノン (すなわち、ステップ B の生成物) (0.29 g、0.65 mmol) を、水酸化カリウム (0.37 g、6.5 mmol) のジオキサン (8 mL) および水 (8 mL) 中の溶液に添加し、これを、次いで、還流で 2 時間加熱した。この反応混合物を 10 mL 1 N 塩酸で中和し、酢酸エチルで抽出して、本発明の化合物である (0.28 g) の表題の生成物を得た。AP⁺ = 432 であった。

【0225】

実施例 10

4 - [3 - (4 - プロモフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 5 - ヒドロキシ - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 78) の調製

4 - [3 - (4 - プロモフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 5 - ヒドロキシ - 2 - (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) - 3 (2 H) - ピリダジノン (すなわち、実施例 9、ステップ C の生成物) (0.22 g、0.52 mmol) のメタノール (4.0 mL) 中の溶液に、0.42 mL の 6 M 塩酸を添加した。この反応混合物を還流で 2 時間加熱し、次いで、追加の 0.42 mL の 6 M 塩酸を添加し、および、加熱はさらに 3 時間継続した。反応混合物を冷却し、次いで、焼結ガラスフリットを通してろ過して、本発明の化合物である表題の生成物を、325 ~ 335 °C で溶融する (dec.) 白色の固体 (0.08 g) として得た。

¹H NMR (DMSO - d₆) 13.06 (s, 1H) 12.07 (bs, 1H) 7

・ 8 7 (s , 1 H) 7 . 7 2 (d , 2 H) 7 . 5 9 (d , 2 H) 6 . 6 8 (s , 1 H) 2 . 1 0 (s , 3 H) 。

【 0 2 2 6 】

実施例 1 1

5 - [3 - (4 - ブロモフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - (シクロプロピルカルボニル) - 1 , 6 - ジヒドロ - 6 - オキソ - 4 - ピリダジニルシクロプロパンカルボキシレート (化合物 8 0) の調製

4 - [3 - (4 - ブロモフェニル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 5 - ヒドロキシ - 3 (2 H) - ピリダジノン (すなわち、実施例 1 0 の生成物) (0 . 0 1 7 g 、 0 . 0 4 9 m m o l) のジクロロメタン (2 m L) 中の溶液に、二塩化シクロプロピルカルボニル (0 . 0 1 6 g 、 0 . 1 6 m m o l) およびトリエチルアミン (0 . 0 2 2 g 、 0 . 2 2 m m o l) を添加した。この混合物を 1 8 時間、室温で攪拌し、飽和水性炭酸ナトリウム溶液で 2 回洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、および、濃縮して、本発明の化合物である表題の化合物 (0 . 0 2 1 g) を得た。

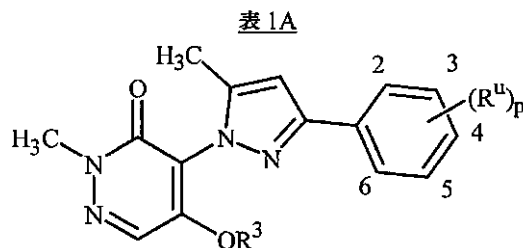
^1H NMR (CDCl_3) 7 . 9 6 (s , 1 H) 7 . 6 6 (m , 2 H) 7 . 5 1 (m , 2 H) 6 . 4 8 (s , 1 H) 2 . 8 8 (m , 1 H) 2 . 7 1 (m , 1 H) 2 . 3 2 (s , 3 H) 1 . 6 9 (m , 2 H) 1 . 1 9 (m , 4 H) 1 . 0 3 (m , 2 H) 。

【 0 2 2 7 】

技術分野において公知である方法と共に、本明細書に記載の手法により、表 1 A ~ 1 1 の以下の化合物を調製することが可能である。以下の略語が以下の表において用いられている： t は第 3 級を意味し、s は第 2 級を意味し、n はノルマルを意味し、i はイソを意味し、c はシクロを意味し、Me はメチルを意味し、Et はエチルを意味し、Pr はプロピルを意味し、i - Pr はイソプロピルを意味し、Bu はブチルを意味し、Ph はフェニルを意味し、CS はチオカルボニル ($\text{C}(\text{S})$) を意味し、CO はカルボニル ($\text{C}(\text{O})$) を意味し、 CO_2 はカルボニルオキシ ($\text{C}(\text{O})\text{O}$) を意味し、SO はスルフィニル ($\text{S}(\text{O})$) を意味し、 SO_2 はスルホニル ($\text{S}(\text{O})_2$) を意味し、 NO_2 はニトロを意味し、OMe はメトキシを意味し、OEt はエトキシを意味し、SMe はメチルチオを意味し、CN および - CN はシアノを意味し、Ph はフェニルを意味し、Py はピリジニルを意味し、TMS はトリメチルシリルを意味し、 $\text{S}(\text{O})\text{Me}$ はメチルスルフィニルを意味し、thien はチオフェンを意味し、ならびに、 $\text{S}(\text{O})_2\text{Me}$ はメチルスルホニルを意味する。表中、「 $(\text{R}^u)_p$ 」は、表中に列挙されているとおり、置換基 R^u の 5 個以下の例を表す。

【 0 2 2 8 】

【表 1】

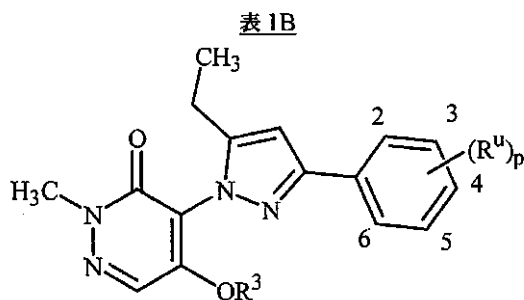
R³はH

(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	10
4-F	4-Me	4-SOMe	4-Ph	20
4-Cl	4-Et	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-2-イル	
4-Br	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₃	4-ピリジン-3-イル	
4-I	4-C≡CH	4-SOCF ₂ H	4-ピリジン-4-イル	
4-CF ₃	4-COMe	4-SO ₂ CF ₃	4-Thien-2-イル	
4-CN	4-COCF ₃	4-SO ₂ CF ₂ H	4-SF ₅	
4-NO ₂	4-COOMe	4-SO ₂ NH ₂	2-Cl	
4-OH	4-CONH ₂	4-SO ₂ NMe ₂	3-Cl	
4-OMe	4-CONHMe	4-SiMe ₃	2-F	
4-OCF ₃	4-CONMe ₂	4-NH ₂	3-F	
4-OCF ₂ H	4-OCOMe	4-NMe ₂	2,4-ジ-Cl	40
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-Cl	
4-CHO	4-SCF ₃	4-NHCOOMe	3,4-ジ-F	
4-CF ₂ H	4-SCF ₂ H	4-NHSO ₂ Me		

R³はCO₂-i-Pr

(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	30
4-F	4-Me	4-SOMe	4-Ph	40
4-Cl	4-Et	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-2-イル	
4-Br	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₃	4-ピリジン-3-イル	
4-I	4-C≡CH	4-SOCF ₂ H	4-ピリジン-4-イル	
4-CF ₃	4-COMe	4-SO ₂ CF ₃	4-Thien-2-イル	
4-CN	4-COCF ₃	4-SO ₂ CF ₂ H	4-SF ₅	
4-NO ₂	4-COOMe	4-SO ₂ NH ₂	2-Cl	
4-OH	4-CONH ₂	4-SO ₂ NMe ₂	3-Cl	
4-OMe	4-CONHMe	4-SiMe ₃	2-F	
4-OCF ₃	4-CONMe ₂	4-NH ₂	3-F	
4-OCF ₂ H	4-OCOMe	4-NMe ₂	2,4-ジ-Cl	40
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-Cl	
4-CHO	4-SCF ₃	4-NHCOOMe	3,4-ジ-F	
4-CF ₂ H	4-SCF ₂ H	4-NHSO ₂ Me		

【表 2】

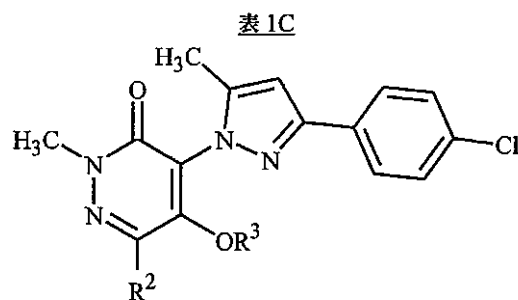
R³はH

(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p
4-F	4-Me	4-SOMe	4-Ph
4-Cl	4-Et	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-2-イル
4-Br	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₃	4-ピリジン-3-イル
4-I	4-C≡CH	4-SOCF ₂ H	4-ピリジン-4-イル
4-CF ₃	4-COMe	4-SO ₂ CF ₃	4-Thien-2-イル
4-CN	4-COCF ₃	4-SO ₂ CF ₂ H	4-SF ₅
4-NO ₂	4-COOMe	4-SO ₂ NH ₂	2-Cl
4-OH	4-CONH ₂	4-SO ₂ NMe ₂	3-Cl
4-OMe	4-CONHMe	4-SiMe ₃	2-F
4-OCF ₃	4-CONMe ₂	4-NH ₂	3-F
4-OCF ₂ H	4-OCOMe	4-NMe ₂	2,4-ジ-Cl
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-Cl
4-CHO	4-SCF ₃	4-NHCOOMe	3,4-ジ-F
4-CF ₂ H	4-SCF ₂ H	4-NHSO ₂ Me	

R³はCO₂-i-Pr

(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p
4-F	4-Me	4-SOMe	4-Ph
4-Cl	4-Et	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-2-イル
4-Br	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₃	4-ピリジン-3-イル
4-I	4-C≡CH	4-SOCF ₂ H	4-ピリジン-4-イル
4-CF ₃	4-COMe	4-SO ₂ CF ₃	4-Thien-2-イル
4-CN	4-COCF ₃	4-SO ₂ CF ₂ H	4-SF ₅
4-NO ₂	4-COOMe	4-SO ₂ NH ₂	2-Cl
4-OH	4-CONH ₂	4-SO ₂ NMe ₂	3-Cl
4-OMe	4-CONHMe	4-SiMe ₃	2-F
4-OCF ₃	4-CONMe ₂	4-NH ₂	3-F
4-OCF ₂ H	4-OCOMe	4-NMe ₂	2,4-ジ-Cl
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-Cl
4-CHO	4-SCF ₃	4-NHCOOMe	3,4-ジ-F
4-CF ₂ H	4-SCF ₂ H	4-NHSO ₂ Me	

【表 3】



R ² はH			
R ³	R ³	R ³	R ³
COMe	COO-t-Bu	SO ₂ -(2,2-ジ-Cl-c-Pr)	PO(Me)SMe
COCH=CH ₂	COO-i-Bu	SO ₂ -(1-Me-c-Pr)	PO(OMe) ₂
COC≡CH	CSSMe	SO ₂ -c-(3-ヘキセン-1-イル)	PS(OMe) ₂
COCF ₃	COSMe	SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	PO(NMe ₂) ₂
COCH ₂ CH=CF ₂	CSOMe	SO ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	PS(NMe ₂) ₂
CO-c-ベンチル	COOCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CH ₂ CH ₂ SOMe	CO-2-Cl-Ph
CO-c-Pr	COOCH ₂ C≡CH	SO ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CO-3-Cl-Ph
CO-(2,2-ジ-Cl-c-Pr)	COCH ₂ CF ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	CO-4-Cl-Ph
CO-(1-Me-c-Pr)	COOCH ₂ CH=CF ₂	SO ₂ Et	CO-2-F-Ph
CO-c-(3-ヘキセン-1-イル)	COO-c-ベンチル	SO ₂ -n-Pr	CO-3-F-Ph
COCH ₂ CH ₂ OMe	COOCH ₂ -c-Pr	SO ₂ -i-Pr	CO-4-F-Ph
COCH ₂ CH ₂ SMe	COCH ₂ -(2,2-ジ-Cl-c-Pr)	SO ₂ -t-Bu	CO-2-CF ₃ -Ph
COCH ₂ CH ₂ SOMe	COCH ₂ -(1-Me-c-Pr)	SO ₂ -i-Bu	CO-3-CF ₃ -Ph
COCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	COO-c-(3-ヘキセン-1-イル)	SO ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	CO-4-CF ₃ -Ph
COCH ₂ CH ₂ NMe ₂	COOCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Ph	SO ₂ -2-Cl-Ph
COEt	COOCH ₂ CH ₂ SMe	SO ₂ CH ₂ Ph	SO ₂ -3-Cl-Ph
CO-n-Pr	COOCH ₂ CH ₂ SOMe	SO ₂ NHMe	SO ₂ -4-Cl-Ph
CO-i-Pr	COOCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	SO ₂ NHCH ₂ CF ₃	SO ₂ -2-F-Ph
CO-t-Bu	COOCH ₂ CH ₂ NMe ₂	SO ₂ NMe ₂	SO ₂ -3-F-Ph
CO-i-Bu	SO ₂ Me	SO ₂ NH-c-Pr	SO ₂ -4-F-Ph
COCH ₂ C(CH ₃) ₃	SO ₂ CH=CH ₂	PO(OEt) ₂	SO ₂ -2-CF ₃ -Ph
COPh	SO ₂ C≡CH	PO(Me)OEt	SO ₂ -3-CF ₃ -Ph
COCH ₂ Ph	SO ₂ CF ₃	PO(Et)OEt	SO ₂ -4-CF ₃ -Ph
COOMe	SO ₂ CH=CF ₂	PS(OEt) ₂	CO-2-OMe-Ph
COOEt	SO ₂ -c-ベンチル	PS(Me)OEt	CO-3-OMe-Ph
COO-i-Pr	SO ₂ -c-Pr	PS(Me)SMe	CO-4-OMe-Ph

10

20

30

40

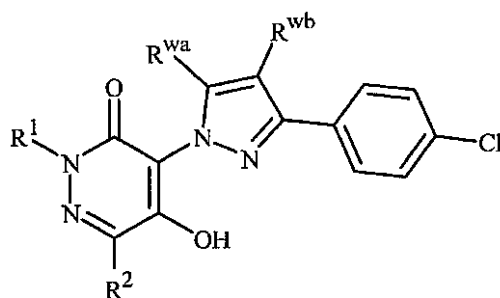
【表 4】

R^2 は CH_3	R^3	R^3	R^3	R^3	
COMe	COO-i-Bu	SO ₂ -c-(3-ヘキセン-1-イル)	PO(NMe ₂) ₂		
COCH=CH ₂	CSSMe	SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	PS(NMe ₂) ₂		
COC≡CH	COSMe	SO ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CO-2-Cl-Ph		
COCF ₃	CSOMe	SO ₂ CH ₂ CH ₂ SOMe	CO-3-Cl-Ph		
COCH ₂ CH=CF ₂	COOCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CO-4-Cl-Ph		10
CO-c-ベンチル	COOCH ₂ C≡CH	SO ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂	CO-2-F-Ph		
CO-c-Pr	COCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et	CO-3-F-Ph		
CO-(2,2-ジ-Cl-c-Pr)	COOCH ₂ CH=CF ₂	SO ₂ -n-Pr	CO-4-F-Ph		
CO-(1-Me-c-Pr)	COO-c-ベンチル	SO ₂ -i-Pr	CO-2-CF ₃ -Ph		
CO-c-(3-ヘキセン-1-イル)	COOCH ₂ -c-Pr	SO ₂ -t-Bu	CO-3-CF ₃ -Ph		
COCH ₂ CH ₂ OMe	COCH ₂ -(2,2-ジ-Cl-c-Pr)	SO ₂ -i-Bu	CO-4-CF ₃ -Ph		
COCH ₂ CH ₂ SMe	COCH ₂ -(1-Me-c-Pr)	SO ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	SO ₂ -2-Cl-Ph		
COCH ₂ CH ₂ SOMe	COO-c-(3-ヘキセン-1-イル)	SO ₂ Ph	SO ₂ -3-Cl-Ph		
COCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	COOCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ CH ₂ Ph	SO ₂ -4-Cl-Ph		20
COCH ₂ CH ₂ NMe ₂	COOCH ₂ CH ₂ SMe	SO ₂ NHMe	SO ₂ -2-F-Ph		
COEt	COOCH ₂ CH ₂ SOMe	SO ₂ NHCH ₂ CF ₃	SO ₂ -3-F-Ph		
CO-n-Pr	COOCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	SO ₂ NMe ₂	SO ₂ -4-F-Ph		
CO-i-Pr	COOCH ₂ CH ₂ NMe ₂	SO ₂ NH-c-Pr	SO ₂ -2-CF ₃ -Ph		
CO-t-Bu	SO ₂ Me	PO(OEt) ₂	SO ₂ -3-CF ₃ -Ph		
CO-i-Bu	SO ₂ CH=CH ₂	PO(Me)OEt	SO ₂ -4-CF ₃ -Ph		
COCH ₂ C(CH ₃) ₃	SO ₂ C≡CH	PO(Et)OEt	CO-2-OMe-Ph		
COPh	SO ₂ CF ₃	PS(OEt) ₂	CO-3-OMe-Ph		30
COCH ₂ Ph	SO ₂ CH=CF ₂	PS(Me)OEt	CO-4-OMe-Ph		
COOMe	SO ₂ -c-ベンチル	PS(Me)SMe			
COOEt	SO ₂ -c-Pr	PO(Me)SMe			
COO-i-Pr	SO ₂ -(2,2-ジ-Cl-c-Pr)	PO(OMe) ₂			
COO-t-Bu	SO ₂ -(1-Me-c-Pr)	PS(OMe) ₂			

【 0 2 3 2 】

【表 5】

表 1D



10

R ¹	R ²	R ^{wa}	R ^{wb}	R ¹	R ²	R ^{wa}	R ^{wb}
Me	Et	Me	H	CH ₂ C≡CH	H	Me	H
Me	n-Pr	Me	H	CH ₂ CF ₃	H	Me	H
Me	i-Pr	Me	H	c-Pr	H	Me	H
Me	i-Bu	Me	H	CH ₂ -c-Pr	H	Me	H
Me	t-Bu	Me	H	c-(3-ヘキセン-1-イル)	H	Me	H
Me	n-Bu	Me	H	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me	H
Me	c-Pr	Me	H	CH ₂ OMe	H	Me	H
Me	CH ₂ CH=CH ₂	Me	H	CH ₂ CH ₂ SMe	H	Me	H
Me	C≡CH	Me	H	CH ₂ CH ₂ SOMe	H	Me	H
Me	F	Me	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	H	Me	H
Me	Cl	Me	H	Me	H	Me	Me
Me	Br	Me	H	Me	H	Me	Cl
Me	CN	Me	H	Me	H	Me	Br
Me	CONH ₂	Me	H	Me	H	Me	F
Me	COOMe	Me	H	Me	H	Me	CF ₃
Me	CH ₂ OMe	Me	H	Me	H	Me	H
Me	CH ₂ SMe	Me	H	Me	H	Me	CN
Me	CH ₂ SOMe	Me	H	Me	H	Me	NO ₂
Me	CH ₂ SO ₂ Me	Me	H	Me	H	Me	SMe
Me	OMe	Me	H	Me	H	Me	SCF ₃
Me	OEt	Me	H	Me	H	H	H
Me	OCF ₂ H	Me	H	Me	H	Et	H
Me	SMe	Me	H	Me	H	n-Pr	H
Me	SCH ₂ CF ₃	Me	H	Me	H	c-Pr	H
H	H	Me	H	Me	H	i-Pr	H
Et	H	Me	H	Me	H	F	H
n-Pr	H	Me	H	Me	H	Cl	H
CH ₂ CH=CH ₂	H	Me	H	Me	H	Br	H

20

30

40

【 0 2 3 3 】

【表 6】

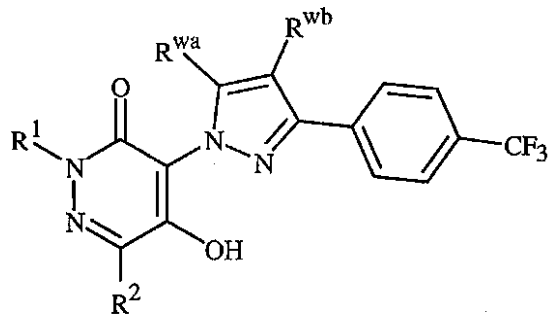
R ¹	R ²	R ^{wa}	R ^{wb}	R ¹	R ²	R ^{wa}	R ^{wb}	
Me	H	CN	H	Me	OMe	c-Pr	H	
Me	H	SMe	H	Me	OMe	Cl	H	
Me	H	CF ₃	H	Me	OMe	Br	H	
Me	H	Et	Me	Me	OMe	Et	Me	
Me	H	n-Pr	Me	Me	OMe	Me	Me	
Me	H	i-Pr	Me	Me	OEt	Et	H	10
Me	H	i-Bu	Me	Me	OEt	Et	Me	
Me	H	t-Bu	Me	Me	NO ₂	Et	H	
Me	H	n-Bu	Me	Me	NO ₂	Me	H	
Me	H	c-Pr	Me	Me	F	Et	H	
Me	H	F	Me	Me	Cl	Et	H	
Me	H	Cl	Me	Me	Br	Et	H	
Me	H	Br	Me	Et	H	Et	H	
Me	H	CN	Me	Et	H	n-Pr	H	20
Me	H	SMe	Me	Et	H	i-Pr	H	
Me	H	CF ₃	Me	Et	H	i-Bu	H	
Me	H	OMe	Me	Et	H	t-Bu	H	
Me	H	Et	Cl	Et	H	n-Bu	H	
Me	H	n-Pr	Cl	Et	H	c-Pr	H	
Me	H	i-Pr	Cl	Et	H	F	H	
Me	H	i-Bu	Cl	Et	H	Cl	H	
Me	H	t-Bu	Cl	Et	H	Br	H	
Me	H	n-Bu	Cl	Et	H	Et	Me	30
Me	H	c-Pr	Cl	H	H	Et	H	
Me	H	F	Cl	H	H	n-Pr	H	
Me	H	Cl	Cl	H	H	i-Pr	H	
Me	H	Br	Cl	H	H	i-Bu	H	
Me	H	CN	Cl	H	H	t-Bu	H	
Me	H	SMe	Cl	H	H	n-Bu	H	
Me	H	CF ₃	Cl	H	H	c-Pr	H	
Me	H	OMe	Cl	H	H	F	H	40
Me	H	Et	F	H	H	Cl	H	
Me	H	n-Pr	F	H	H	Br	H	
Me	OMe	Et	H	H	H	Et	Me	
Me	OMe	n-Pr	H					

【 0 2 3 4 】

表 1 E

表 1 E は、表 1 D の見出しの化学構造が以下の構造で置き換えられていること以外、表 1 D と同じく構成されている。

【化 2 0】



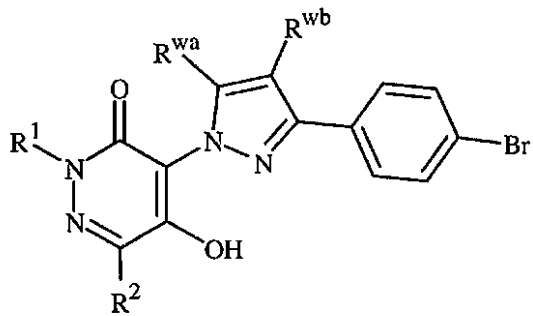
10

【 0 2 3 5】

表 1 F

表 1 F は、表 1 D の見出しの化学構造が以下の構造で置き換えられていること以外、表 1 D と同じく構成されている。

【化 2 1】



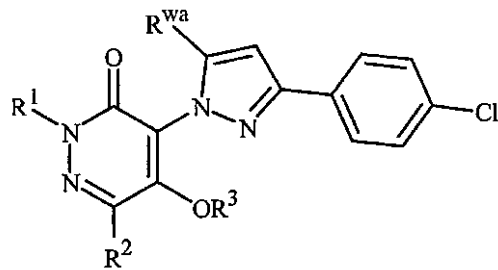
20

【 0 2 3 6】

【表 7】

表 1G

30



40

R²はH

R¹	R³	Rᵂᵃ	R¹	R³	Rᵂᵃ
COEt	COEt	Et	CO-i-Bu	CO-i-Bu	Et
CO-n-Pr	CO-n-Pr	Et	COCH₂C(CH₃)₃	COCH₂C(CH₃)₃	Et
CO-i-Pr	CO-i-Pr	Et	COPh	COPh	Et
CO-t-Bu	CO-t-Bu	Et	COOMe	COOMe	Et

【 0 2 3 7】

【表 8】

R ¹	R ³	R ^{wa}	R ¹	R ³	R ^{wa}	
COOEt	COOEt	Et	H	SO ₂ -n-Pr	Et	
COO-i-Pr	COO-i-Pr	Et	H	SO ₂ -i-Pr	Et	
COO-t-Bu	COO-t-Bu	Et	H	SO ₂ -t-Bu	Et	
COO-i-Bu	COO-i-Bu	Et	H	SO ₂ -i-Bu	Et	
COCH ₂ CF ₃	COCH ₂ CF ₃	Et	H	SO ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	Et	
SO ₂ Me	SO ₂ Me	Et	H	SO ₂ Ph	Et	10
SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	Et	H	SO ₂ NMe ₂	Et	
SO ₂ -c-Pr	SO ₂ -c-Pr	Et	H	PO(OEt) ₂	Et	
SO ₂ Et	SO ₂ Et	Et	H	PO(Me)OEt	Et	
SO ₂ -n-Pr	SO ₂ -n-Pr	Et	H	PS(OEt) ₂	Et	
SO ₂ -i-Pr	SO ₂ -i-Pr	Et	H	PO(OMe) ₂	Et	
SO ₂ -t-Bu	SO ₂ -t-Bu	Et	COEt	COEt	Me	
SO ₂ -i-Bu	SO ₂ -i-Bu	Et	CO-n-Pr	CO-n-Pr	Me	
SO ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	SO ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	Et	CO-i-Pr	CO-i-Pr	Me	20
SO ₂ Ph	SO ₂ Ph	Et	CO-t-Bu	CO-t-Bu	Me	
SO ₂ NMe ₂	SO ₂ NMe ₂	Et	CO-i-Bu	CO-i-Bu	Me	
PO(OEt) ₂	PO(OEt) ₂	Et	COCH ₂ C(CH ₃) ₃	COCH ₂ C(CH ₃) ₃	Me	
PO(Me)OEt	PO(Me)OEt	Et	COPh	COPh	Me	
PS(OEt) ₂	PS(OEt) ₂	Et	COOMe	COOMe	Me	
PO(OMe) ₂	PO(OMe) ₂	Et	COOEt	COOEt	Me	
H	COEt	Et	COO-i-Pr	COO-i-Pr	Me	
H	CO-n-Pr	Et	COO-t-Bu	COO-t-Bu	Me	
H	CO-i-Pr	Et	COO-i-Bu	COO-i-Bu	Me	30
H	CO-t-Bu	Et	COCH ₂ CF ₃	COCH ₂ CF ₃	Me	
H	CO-i-Bu	Et	SO ₂ Me	SO ₂ Me	Me	
H	COCH ₂ C(CH ₃) ₃	Et	SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	
H	COPh	Et	SO ₂ -c-Pr	SO ₂ -c-Pr	Me	
H	COOMe	Et	SO ₂ Et	SO ₂ Et	Me	
H	COOEt	Et	SO ₂ -n-Pr	SO ₂ -n-Pr	Me	
H	COO-i-Pr	Et	SO ₂ -i-Pr	SO ₂ -i-Pr	Me	
H	COO-t-Bu	Et	SO ₂ -t-Bu	SO ₂ -t-Bu	Me	40
H	COO-i-Bu	Et	SO ₂ -i-Bu	SO ₂ -i-Bu	Me	
H	COCH ₂ CF ₃	Et	SO ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	SO ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	Me	
H	SO ₂ Me	Et	SO ₂ Ph	SO ₂ Ph	Me	
H	SO ₂ CF ₃	Et	SO ₂ NMe ₂	SO ₂ NMe ₂	Me	
H	SO ₂ -c-Pr	Et	PO(OEt) ₂	PO(OEt) ₂	Me	
H	SO ₂ Et	Et	PO(Me)OEt	PO(Me)OEt	Me	

【表 9】

R ¹	R ³	R ^{wa}	R ¹	R ³	R ^{wa}
PS(OEt) ₂	PS(OEt) ₂	Me	H	SO ₂ Me	Me
PO(OMe) ₂	PO(OMe) ₂	Me	H	SO ₂ CF ₃	Me
H	COEt	Me	H	SO ₂ -c-Pr	Me
H	CO-n-Pr	Me	H	SO ₂ Et	Me
H	CO-i-Pr	Me	H	SO ₂ -n-Pr	Me
H	CO-t-Bu	Me	H	SO ₂ -i-Pr	Me
H	CO-i-Bu	Me	H	SO ₂ -t-Bu	Me
H	COCH ₂ C(CH ₃) ₃	Me	H	SO ₂ -i-Bu	Me
H	COPh	Me	H	SO ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	Me
H	COOMe	Me	H	SO ₂ Ph	Me
H	COOEt	Me	H	SO ₂ NMe ₂	Me
H	COO-i-Pr	Me	H	PO(OEt) ₂	Me
H	COO-t-Bu	Me	H	PO(Me)OEt	Me
H	COO-i-Bu	Me	H	PS(OEt) ₂	Me
H	COCH ₂ CF ₃	Me	H	PO(OMe) ₂	Me

10

20

【0239】

表 1 G A

表 1 G A は、表 1 G の見出しの化学構造の下に「R² は H である」が「R² は Me である」で置き換えられていること以外、表 1 G と同じく構成されている。

【0240】

表 1 G B

表 1 G B は、表 1 G の見出しの化学構造の下に「R² は H である」が「R² は OMe である」で置き換えられていること以外、表 1 G と同じく構成されている。

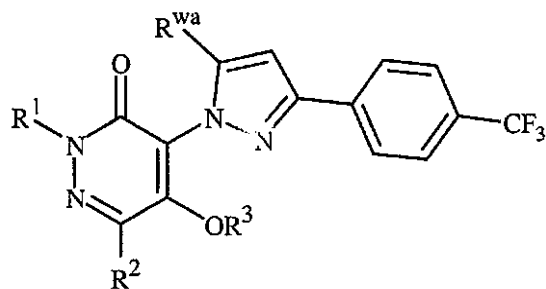
30

【0241】

表 1 H

表 1 H は、表 1 G の見出しの化学構造が以下の構造で置き換えられていること以外、表 1 G と同じく構成されている。

【化 2 2】



40

【0242】

表 1 H A

表 1 H A は、「R² は H である」が「R² は Me である」で置き換えられていること以外、表 1 H と同じく構成されている。

【0243】

表 1 H B

50

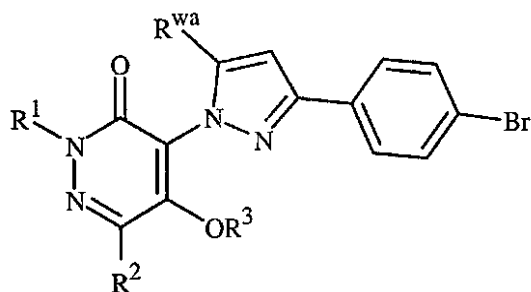
表 1 H B は、「R² は H である」が「R² は OMe である」で置き換えられていること以外、表 1 H と同じく構成されている。

【 0 2 4 4 】

表 1 I

表 1 I は、表 1 G の見出しの化学構造が以下の構造で置き換えられていること以外、表 1 G と同じく構成されている。

【化 2 3】



10

【 0 2 4 5 】

表 1 I A

表 1 I A は、「 R^2 は H である」が「 R^2 は Me である」で置き換えられていること以外、表 1 I と同じく構成されている。

20

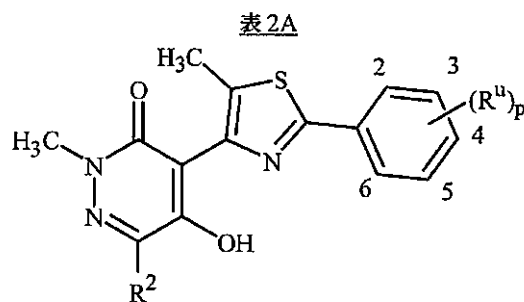
【 0 2 4 6 】

表 1 I B

表 1 I B は、「R² は H である」が「R² は OMe である」で置き換えられていること以外、表 1 I と同じく構成されている。

【 0 2 4 7 】

【表 10】

R²はH

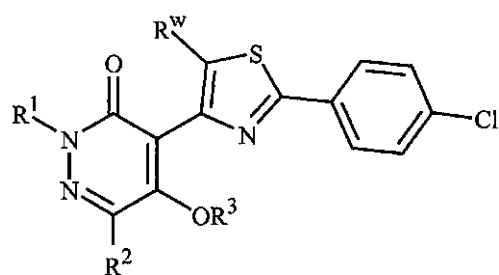
(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p
4-F	4-Me	4-SOMe	4-Ph
4-Cl	4-Et	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-2-イル
4-Br	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₃	4-ピリジン-3-イル
4-I	4-C≡CH	4-SOCF ₂ H	4-ピリジン-4-イル
4-CF ₃	4-COMe	4-SO ₂ CF ₃	4-Thien-2-イル
4-CN	4-COCF ₃	4-SO ₂ CF ₂ H	4-SF ₅
4-NO ₂	4-COOMe	4-SO ₂ NH ₂	2-Cl
4-OH	4-CONH ₂	4-SO ₂ NMe ₂	3-Cl
4-OMe	4-CONHMe	4-SiMe ₃	2-F
4-OCF ₃	4-CONMe ₂	4-NH ₂	3-F
4-OCF ₂ H	4-OCOMe	4-NMe ₂	2,4-ジ-Cl
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-Cl
4-CHO	4-SCF ₃	4-NHCOOMe	3,4-ジ-F
4-CF ₂ H	4-SCF ₂ H	4-NHSO ₂ Me	

R²はCH₃

(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p
4-F	4-Me	4-SOMe	4-Ph
4-Cl	4-Et	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-2-イル
4-Br	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₃	4-ピリジン-3-イル
4-I	4-C≡CH	4-SOCF ₂ H	4-ピリジン-4-イル
4-CF ₃	4-COMe	4-SO ₂ CF ₃	4-Thien-2-イル
4-CN	4-COCF ₃	4-SO ₂ CF ₂ H	4-SF ₅
4-NO ₂	4-COOMe	4-SO ₂ NH ₂	2-Cl
4-OH	4-CONH ₂	4-SO ₂ NMe ₂	3-Cl
4-OMe	4-CONHMe	4-SiMe ₃	2-F
4-OCF ₃	4-CONMe ₂	4-NH ₂	3-F
4-OCF ₂ H	4-OCOMe	4-NMe ₂	2,4-ジ-Cl
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-Cl
4-CHO	4-SCF ₃	4-NHCOOMe	3,4-ジ-F
4-CF ₂ H	4-SCF ₂ H	4-NHSO ₂ Me	

【表 1 1】

表 2B

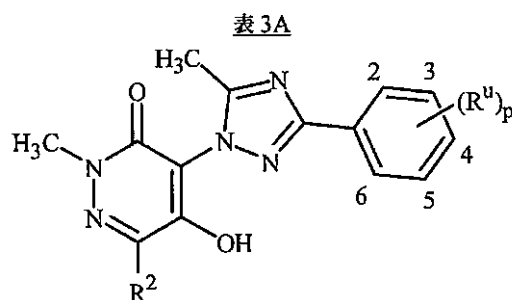
R¹はMeおよびR^wはMe

R ²	R ³	R ²	R ³
H	COMe	n-Bu	H
H	COCH=CH ₂	c-Pr	H
H	COC≡CH	CH ₂ CH=CH ₂	H
H	COCF ₃	C≡CH	H
H	COCH ₂ CH=CF ₂	F	H
H	CO-c-ペンチル	Cl	H
H	CO-c-Pr	Br	H
H	CO-(2,2-ジ-Cl-c-Pr)	-CN	H
H	CO-(1-Me-c-Pr)	CONH ₂	H
H	CO-c-(3-ヘキセン-1-イル)	COOMe	H
H	COCH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ OMe	H
H	COCH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ SMe	H
H	COCH ₂ CH ₂ SOMe	CH ₂ SOMe	H
H	COCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ SO ₂ Me	H
H	COCH ₂ CH ₂ NMe ₂	OMe	H
Et	H	OEt	H
n-Pr	H	OCF ₂ H	H
i-Pr	H	SMe	H
i-Bu	H	SCH ₂ CF ₃	H
t-Bu	H		

R²はHおよびR³はH

R ¹	R ^w	R ¹	R ^w	R ¹	R ^w
H	Me	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me	i-Pr
Et	Me	CH ₂ OMe	Me	Me	F
n-Pr	Me	CH ₂ CH ₂ SMe	Me	Me	Cl
CH ₂ CH=CH ₂	Me	CH ₂ CH ₂ SOMe	Me	Me	Br
CH ₂ C≡CH	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	Me	-CN
CH ₂ CF ₃	Me	Me	H	Me	SMe
c-Pr	Me	Me	Et	Me	CF ₃
CH ₂ -c-Pr	Me	Me	n-Pr		
c-(3-ヘキセン-1-イル)	Me	Me	c-Pr		

【表 1 2】

R²はH

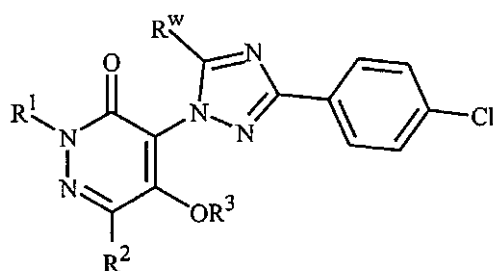
(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p
4-F	4-Me	4-SOMe	4-Ph
4-Cl	4-Et	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-2-イル
4-Br	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₃	4-ピリジン-3-イル
4-I	4-C≡CH	4-SOCF ₂ H	4-ピリジン-4-イル
4-CF ₃	4-COMe	4-SO ₂ CF ₃	4-Thien-2-イル
4-CN	4-COCF ₃	4-SO ₂ CF ₂ H	4-SF ₅
4-NO ₂	4-COOMe	4-SO ₂ NH ₂	2-Cl
4-OH	4-CONH ₂	4-SO ₂ NMe ₂	3-Cl
4-OMe	4-CONHMe	4-SiMe ₃	2-F
4-OCF ₃	4-CONMe ₂	4-NH ₂	3-F
4-OCF ₂ H	4-OCOMe	4-NMe ₂	2,4-ジ-Cl
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-Cl
4-CHO	4-SCF ₃	4-NHCOOMe	3,4-ジ-F
4-CF ₂ H	4-SCF ₂ H	4-NHSO ₂ Me	

R²はCH₃

(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p
4-F	4-Me	4-SOMe	4-Ph
4-Cl	4-Et	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-2-イル
4-Br	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₃	4-ピリジン-3-イル
4-I	4-C≡CH	4-SOCF ₂ H	4-ピリジン-4-イル
4-CF ₃	4-COMe	4-SO ₂ CF ₃	4-Thien-2-イル
4-CN	4-COCF ₃	4-SO ₂ CF ₂ H	4-SF ₅
4-NO ₂	4-COOMe	4-SO ₂ NH ₂	2-Cl
4-OH	4-CONH ₂	4-SO ₂ NMe ₂	3-Cl
4-OMe	4-CONHMe	4-SiMe ₃	2-F
4-OCF ₃	4-CONMe ₂	4-NH ₂	3-F
4-OCF ₂ H	4-OCOMe	4-NMe ₂	2,4-ジ-Cl
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-Cl
4-CHO	4-SCF ₃	4-NHCOOMe	3,4-ジ-F
4-CF ₂ H	4-SCF ₂ H	4-NHSO ₂ Me	

【表 1 3】

表 3B

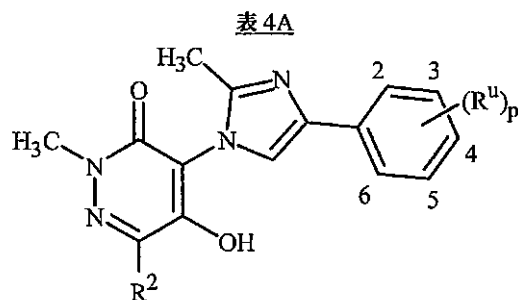
R¹はMeおよびR^wはMe

R ¹	R ²	R ³	R ^w	R ¹	R ²	R ³	R ^w
Me	H	COMe	Me	Me	n-Bu	H	Me
Me	H	COCH=CH ₂	Me	Me	c-Pr	H	Me
Me	H	COC≡CH	Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	H	Me
Me	H	COCF ₃	Me	Me	C≡CH	H	Me
Me	H	COCH ₂ CH=CF ₂	Me	Me	F	H	Me
Me	H	CO-c-ベンチル	Me	Me	Cl	H	Me
Me	H	CO-c-Pr	Me	Me	Br	H	Me
Me	H	CO-(2,2-ジ-Cl-c-Pr)	Me	Me	-CN	H	Me
Me	H	CO-(1-Me-c-Pr)	Me	Me	CONH ₂	H	Me
Me	H	CO-c-(3-ヘキセン-1-イル)	Me	Me	COOMe	H	Me
Me	H	COCH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me	CH ₂ OMe	H	Me
Me	H	COCH ₂ CH ₂ SMe	Me	Me	CH ₂ SMe	H	Me
Me	H	COCH ₂ CH ₂ SOMe	Me	Me	CH ₂ SOMe	H	Me
Me	H	COCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	Me	CH ₂ SO ₂ Me	H	Me
Me	H	COCH ₂ CH ₂ NMe ₂	Me	Me	OMe	H	Me
Me	Et	H	Me	Me	OEt	H	Me
Me	n-Pr	H	Me	Me	OCF ₂ H	H	Me
Me	i-Pr	H	Me	Me	SMe	H	Me
Me	i-Bu	H	Me	Me	SCH ₂ CF ₃	H	Me
Me	t-Bu	H	Me				

R²はHおよびR³はH

R ¹	R ^w	R ¹	R ^w	R ¹	R ^w
H	Me	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Me	i-Pr
Et	Me	CH ₂ OMe	Me	Me	F
n-Pr	Me	CH ₂ CH ₂ SMe	Me	Me	Cl
CH ₂ CH=CH ₂	Me	CH ₂ CH ₂ SOMe	Me	Me	Br
CH ₂ C≡CH	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	Me	CN
CH ₂ CF ₃	Me	Me	H	Me	SMe
c-Pr	Me	Me	Et	Me	CF ₃
CH ₂ -c-Pr	Me	Me	n-Pr	Et	Me
c-(3-ヘキセン-1-イル)	Me	Me	c-Pr		

【表 1 4】

R²はH

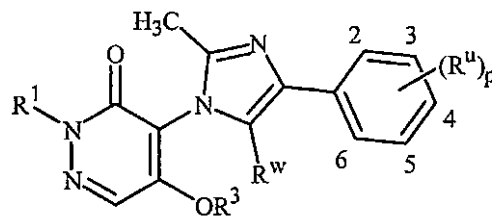
(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p
4-F	4-Me	4-SOMe	4-Ph
4-Cl	4-Et	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-2-イル
4-Br	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₃	4-ピリジン-3-イル
4-I	4-C≡CH	4-SOCF ₂ H	4-ピリジン-4-イル
4-CF ₃	4-COMe	4-SO ₂ CF ₃	4-Thien-2-イル
4-CN	4-COCF ₃	4-SO ₂ CF ₂ H	4-SF ₅
4-NO ₂	4-COOMe	4-SO ₂ NH ₂	2-Cl
4-OH	4-CONH ₂	4-SO ₂ NMe ₂	3-Cl
4-OMe	4-CONHMe	4-SiMe ₃	2-F
4-OCF ₃	4-CONMe ₂	4-NH ₂	3-F
4-OCF ₂ H	4-OCOMe	4-NMe ₂	2,4-ジ-Cl
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-Cl
4-CHO	4-SCF ₃	4-NHCOOMe	3,4-ジ-F
4-CF ₂ H	4-SCF ₂ H	4-NHSO ₂ Me	

R²はCH₃

(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p
4-F	4-Et	4-SOCF ₃	4-ピリジン-4-イル
4-Cl	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₂ H	4-Thien-2-イル
4-Br	4-C≡CH	4-SO ₂ CF ₃	4-SF ₅
4-I	4-COMe	4-SO ₂ CF ₂ H	2-Cl
4-CF ₃	4-COCF ₃	4-SO ₂ NH ₂	3-Cl
4-CN	4-COOMe	4-SO ₂ NMe ₂	2-F
4-NO ₂	4-CONH ₂	4-SiMe ₃	3-F
4-OH	4-CONHMe	4-NH ₂	2,4-ジ-Cl
4-OMe	4-CONMe ₂	4-NMe ₂	3,4-ジ-Cl
4-OCF ₃	4-OCOMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-F
4-OCF ₂ H	4-SMe	4-NHCOOMe	
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SCF ₃	4-NHSO ₂ Me	
4-CHO	4-SCF ₂ H	4-Ph	
4-CF ₂ H	4-SOMe	4-ピリジン-2-イル	
4-Me	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-3-イル	

【表 1 5】

表 4B



R ¹	R ³	R ^w	(R ^u) _p	R ¹	R ³	R ^w	(R ^u) _p
Me	H	Me	4-Cl	Me	CO-t-Bu	H	4-Cl
Me	H	Me	4-F	Me	CO-i-Bu	H	4-Cl
Me	H	Me	4-Br	Me	COCH ₂ C(CH ₃) ₃	H	4-Cl
Me	H	Me	4-CF ₃	Me	COPh	H	4-Cl
Me	H	Me	4-CN	Me	COOMe	H	4-Cl
Me	H	Me	4-NO ₂	Me	COOEt	H	4-Cl
Me	H	Me	4-OMe	Me	COO-i-Pr	H	4-Cl
Me	H	Me	4-OCF ₃	Me	COO-t-Bu	H	4-Cl
Me	H	Me	4-OCF ₂ H	Me	COO-i-Bu	H	4-Cl
Me	H	Me	4-OCF ₂ CF ₃ H	Me	COCH ₂ CF ₃	H	4-Cl
Me	H	Me	4-CHO	Me	SO ₂ Me	H	4-Cl
Me	H	Me	4-CF ₂ H	Me	SO ₂ CF ₃	H	4-Cl
Me	H	Me	4-Me	Me	SO ₂ -c-Pr	H	4-Cl
Me	H	Me	4-Et	Me	SO ₂ Et	H	4-Cl
Me	H	Me	4-SMe	Me	SO ₂ -n-Pr	H	4-Cl
Me	H	Me	4-SCF ₃	Me	SO ₂ -i-Pr	H	4-Cl
Me	H	Me	4-SCF ₂ H	Me	SO ₂ -t-Bu	H	4-Cl
Me	H	Me	2-Cl	Me	SO ₂ -i-Bu	H	4-Cl
Me	H	Me	3-Cl	Me	SO ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	H	4-Cl
Me	H	Me	2-F	Me	SO ₂ Ph	H	4-Cl
Me	H	Me	3-F	Me	SO ₂ NMe ₂	H	4-Cl
Me	H	Me	2,4-ジ-Cl	Me	PO(OEt) ₂	H	4-Cl
Me	H	Me	3,4-ジ-Cl	Me	PO(Me)OEt	H	4-Cl
Me	H	Me	3,4-ジ-F	Me	PS(OEt) ₂	H	4-Cl
Me	COEt	H	4-Cl	Me	PO(OMe) ₂	H	4-Cl
Me	CO-n-Pr	H	4-Cl	Et	H	H	4-Cl
Me	CO-i-Pr	H	4-Cl				

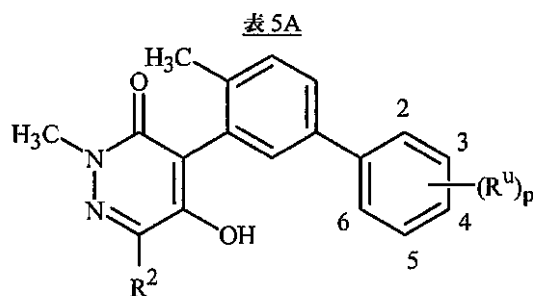
10

20

30

40

【表 16】

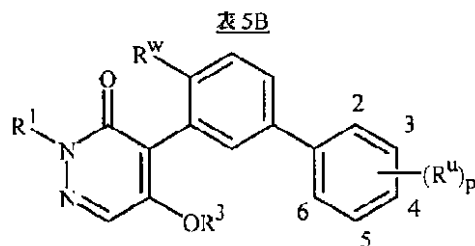
R²はH

(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p
4-F	4-Me	4-SOMe	4-Ph
4-Cl	4-Et	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-2-イル
4-Br	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₃	4-ピリジン-3-イル
4-I	4-C≡CH	4-SOCF ₂ H	4-ピリジン-4-イル
4-CF ₃	4-COMe	4-SO ₂ CF ₃	4-Thien-2-イル
4-CN	4-COCF ₃	4-SO ₂ CF ₂ H	4-SF ₅
4-NO ₂	4-COOMe	4-SO ₂ NH ₂	2-Cl
4-OH	4-CONH ₂	4-SO ₂ NMe ₂	3-Cl
4-OMe	4-CONHMe	4-SiMe ₃	2-F
4-OCF ₃	4-CONMe ₂	4-NH ₂	3-F
4-OCF ₂ H	4-OCOMe	4-NMe ₂	2,4-ジ-Cl
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-Cl
4-CHO	4-SCF ₃	4-NHCOOMe	3,4-ジ-F
4-CF ₂ H	4-SCF ₂ H	4-NHSO ₂ Me	

R²はCH₃

(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p
4-F	4-Me	4-SOMe	4-Ph
4-Cl	4-Et	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-2-イル
4-Br	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₃	4-ピリジン-3-イル
4-I	4-C≡CH	4-SOCF ₂ H	4-ピリジン-4-イル
4-CF ₃	4-COMe	4-SO ₂ CF ₃	4-Thien-2-イル
4-CN	4-COCF ₃	4-SO ₂ CF ₂ H	4-SF ₅
4-NO ₂	4-COOMe	4-SO ₂ NH ₂	2-Cl
4-OH	4-CONH ₂	4-SO ₂ NMe ₂	3-Cl
4-OMe	4-CONHMe	4-SiMe ₃	2-F
4-OCF ₃	4-CONMe ₂	4-NH ₂	3-F
4-OCF ₂ H	4-OCOMe	4-NMe ₂	2,4-ジ-Cl
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-Cl
4-CHO	4-SCF ₃	4-NHCOOMe	3,4-ジ-F
4-CF ₂ H	4-SCF ₂ H	4-NHSO ₂ Me	

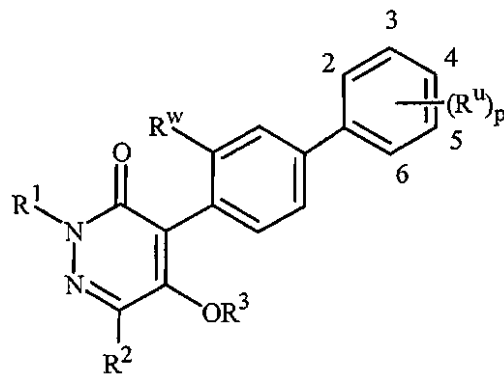
【表 17】



R ¹	R ³	R ^w	(R ^u) _p	R ¹	R ³	R ^w	(R ^u) _p	
Me	COEt	Me	4-Cl	Me	H	Cl	4-CF ₂ H	10
Me	CO-n-Pr	Me	4-Cl	Me	H	Cl	4-Me	
Me	CO-i-Pr	Me	4-Cl	Me	H	Cl	4-Et	
Me	CO-t-Bu	Me	4-Cl	Me	H	Cl	4-SMe	
Me	CO-i-Bu	Me	4-Cl	Me	H	Cl	4-SCF ₃	
Me	COCH ₂ C(CH ₃) ₃	Me	4-Cl	Me	H	Cl	4-SCF ₂ H	
Me	COPh	Me	4-Cl	Me	H	Cl	2-Cl	
Me	COOMe	Me	4-Cl	Me	H	Cl	3-Cl	
Me	COOEt	Me	4-Cl	Me	H	Cl	2-F	
Me	COO-i-Pr	Me	4-Cl	Me	H	Cl	3-F	
Me	COO-t-Bu	Me	4-Cl	Me	H	Cl	2,4-ジ-Cl	20
Me	COO-i-Bu	Me	4-Cl	Me	H	Cl	3,4-ジ-Cl	
Me	COCH ₂ CF ₃	Me	4-Cl	Me	H	Cl	3,4-ジ-F	
Me	SO ₂ Me	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-Cl	
Me	SO ₂ CF ₃	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-F	
Me	SO ₂ -c-Pr	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-Br	
Me	SO ₂ Et	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-CF ₃	
Me	SO ₂ -n-Pr	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-CN	
Me	SO ₂ -i-Pr	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-NO ₂	
Me	SO ₂ -t-Bu	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-OMe	
Me	SO ₂ -i-Bu	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-OCF ₃	30
Me	SO ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-OCF ₂ H	
Me	SO ₂ Ph	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-OCF ₂ CF ₂ H	
Me	SO ₂ NMe ₂	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-CHO	
Me	PO(OEt) ₂	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-CF ₂ H	
Me	PO(Me)OEt	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-Me	
Me	PS(OEt) ₂	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-Et	
Me	PO(OMe) ₂	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-SMe	
Me	H	Cl	4-Cl	Me	H	Et	4-SCF ₃	
Me	H	Cl	4-F	Me	H	Et	4-SCF ₂ H	
Me	H	Cl	4-Br	Me	H	Et	2-Cl	40
Me	H	Cl	4-CF ₃	Me	H	Et	3-Cl	
Me	H	Cl	4-CN	Me	H	Et	2-F	
Me	H	Cl	4-NO ₂	Me	H	Et	3-F	
Me	H	Cl	4-OMe	Me	H	Et	2,4-ジ-Cl	
Me	H	Cl	4-OCF ₃	Me	H	Et	3,4-ジ-Cl	
Me	H	Cl	4-OCF ₂ H	Me	H	Et	3,4-ジ-F	
Me	H	Cl	4-OCF ₂ CF ₂ H	Et	H	Me	4-Cl	
Me	H	Cl	4-CHO					

【表 1 8】

表 5C



10

【 0 2 5 6 】

【表 19】

R²はH

R ¹	R ³	R ^w	(R ^u) _p	R ¹	R ³	R ^w	(R ^u) _p	
Me	COEt	Me	4-Cl	Me	H	Cl	4-OCF ₂ CF ₂ H	
Me	CO-n-Pr	Me	4-Cl	Me	H	Cl	4-CHO	
Me	CO-i-Pr	Me	4-Cl	Me	H	Cl	4-CF ₂ H	
Me	CO-t-Bu	Me	4-Cl	Me	H	Cl	4-Me	
Me	CO-i-Bu	Me	4-Cl	Me	H	Cl	4-Et	10
Me	COCH ₂ C(CH ₃) ₃	Me	4-Cl	Me	H	Cl	4-SMe	
Me	COPh	Me	4-Cl	Me	H	Cl	4-SCF ₃	
Me	COOMe	Me	4-Cl	Me	H	Cl	4-SCF ₂ H	
Me	COOEt	Me	4-Cl	Me	H	Cl	2-Cl	
Me	COO-i-Pr	Me	4-Cl	Me	H	Cl	3-Cl	
Me	COO-t-Bu	Me	4-Cl	Me	H	Cl	2-F	
Me	COO-i-Bu	Me	4-Cl	Me	H	Cl	3-F	
Me	COCH ₂ CF ₃	Me	4-Cl	Me	H	Cl	2,4-ジ-Cl	
Me	SO ₂ Me	Me	4-Cl	Me	H	Cl	3,4-ジ-Cl	20
Me	SO ₂ CF ₃	Me	4-Cl	Me	H	Cl	3,4-ジ-F	
Me	SO ₂ -c-Pr	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-Cl	
Me	SO ₂ Et	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-F	
Me	SO ₂ -n-Pr	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-Br	
Me	SO ₂ -i-Pr	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-CF ₃	
Me	SO ₂ -t-Bu	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-CN	
Me	SO ₂ -i-Bu	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-NO ₂	
Me	SO ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-OMe	30
Me	SO ₂ Ph	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-OCF ₃	
Me	SO ₂ NMe ₂	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-OCF ₂ H	
Me	PO(OEt) ₂	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-OCF ₂ CF ₂ H	
Me	PO(Me)OEt	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-CHO	
Me	PS(OEt) ₂	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-CF ₂ H	
Me	PO(OMe) ₂	Me	4-Cl	Me	H	Et	4-Me	
Me	H	Cl	4-Cl	Me	H	Et	4-Et	
Me	H	Cl	4-F	Me	H	Et	4-SMe	
Me	H	Cl	4-Br	Me	H	Et	4-SCF ₃	40
Me	H	Cl	4-CF ₃	Me	H	Et	4-SCF ₂ H	
Me	H	Cl	4-CN	Me	H	Et	2-Cl	
Me	H	Cl	4-NO ₂	Me	H	Et	3-Cl	
Me	H	Cl	4-OMe	Me	H	Et	2-F	
Me	H	Cl	4-OCF ₃	Me	H	Et	3-F	
Me	H	Cl	4-OCF ₂ H	Me	H	Et	2,4-ジ-Cl	

【0257】

【表 2 0】

R^1	R^3	R^w	$(R^u)_p$	R^1	R^3	R^w	$(R^u)_p$	
Me	H	Et	3,4-ジ-Cl	Me	H	Me	4-Cl	
Me	H	Et	3,4-ジ-F	Me	H	Me	4-Cl	
Et	H	Me	4-Cl	Me	H	Me	4-Cl	
Me	H	Me	4-Cl	Me	H	Me	4-Cl	
Me	H	Me	4-Cl	Me	H	Me	4-Cl	
Me	H	Me	4-Cl	Me	H	Me	4-Cl	10
Me	H	Me	4-Cl	Me	H	Me	4-Cl	
Me	H	Me	4-Cl	Me	H	Me	4-Cl	
Me	H	Me	4-Cl	Me	H	Me	4-Cl	
Me	H	Me	4-Cl	Me	H	Me	4-Cl	
Me	H	Me	4-Cl	Me	H	Me	4-Cl	
Me	H	Me	4-Cl	Me	H	Me	4-Cl	
Me	H	Me	4-Cl	Me	H	Me	4-Cl	
Me	H	Me	4-Cl	Me	H	Me	4-Cl	
Me	H	Me	4-Cl	Me	H	Me	4-Cl	20
Me	H	Me	4-Cl	Me	H	Me	4-Cl	

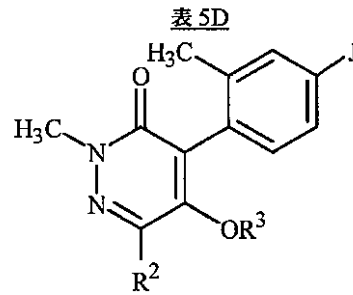
【 0 2 5 8】

表 5 C A

表 5 C A は、表 5 C の見出しの化学構造の下に「 R^2 は H である」が「 R^2 は Me である」で置き換えられていること以外、表 5 C と同じく構成されている。

【 0 2 5 9】

【表 2 1】



R ²	R ³	J	R ²	R ³	J
H	H	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	3-Cl-1H-ピラゾール-1-イル
H	H	3-Br-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	4-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
H	H	3-Me-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	4-Br-1H-ピラゾール-1-イル
H	H	3-Cl-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	4-Me-1H-ピラゾール-1-イル
H	H	4-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	4-Cl-1H-ピラゾール-1-イル
H	H	4-Br-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	4-CN-1H-ピラゾール-1-イル
H	H	4-Me-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	3-Me-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
H	H	4-Cl-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	3-Br-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
H	H	4-CN-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	3-CF ₃ -1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
H	H	3-Me-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル	Me	H	4-CF ₃ -1H-イミダゾール-1-イル
H	H	3-Br-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル	Me	H	4-Me-1H-イミダゾール-1-イル
H	H	3-CF ₃ -1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル	Me	H	4-Cl-1H-イミダゾール-1-イル
H	H	4-CF ₃ -1H-イミダゾール-1-イル	Me	H	5-CF ₃ -ピリジン-2-イル
H	H	4-Me-1H-イミダゾール-1-イル	Me	H	5-Cl-ピリジン-2-イル
H	H	4-Cl-1H-イミダゾール-1-イル	Me	H	2-Cl-ピリジン-5-イル
H	H	5-CF ₃ -ピリジン-2-イル	Me	H	5-Cl-thien-2-イル
H	H	5-Cl-ピリジン-2-イル	H	COO-i-Pr	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
H	H	2-Cl-ピリジン-5-イル	H	CO-i-Pr	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
H	H	5-Cl-thien-2-イル	H	SO ₂ Me	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
Me	H	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル	H	SO ₂ Ph	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
Me	H	3-Br-1H-ピラゾール-1-イル	H	CO-t-Bu	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
Me	H	3-Me-1H-ピラゾール-1-イル			

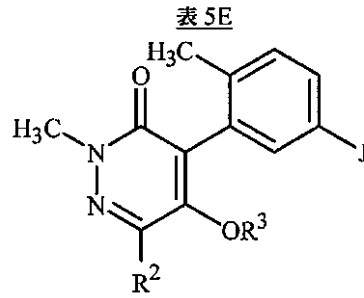
10

20

30

【 0 2 6 0 】

【表 2 2】



R ²	R ³	J	R ²	R ³	J
H	H	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	3-Cl-1H-ピラゾール-1-イル
H	H	3-Br-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	4-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
H	H	3-Me-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	4-Br-1H-ピラゾール-1-イル
H	H	3-Cl-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	4-Me-1H-ピラゾール-1-イル
H	H	4-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	4-Cl-1H-ピラゾール-1-イル
H	H	4-Br-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	4-CN-1H-ピラゾール-1-イル
H	H	4-Me-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	3-Me-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
H	H	4-Cl-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	3-Br-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
H	H	4-CN-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	3-CF ₃ -1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
H	H	3-Me-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル	Me	H	4-CF ₃ -1H-イミダゾール-1-イル
H	H	3-Br-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル	Me	H	4-Me-1H-イミダゾール-1-イル
H	H	3-CF ₃ -1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル	Me	H	4-Cl-1H-イミダゾール-1-イル
H	H	4-CF ₃ -1H-イミダゾール-1-イル	Me	H	5-CF ₃ -ピリジン-2-イル
H	H	4-Me-1H-イミダゾール-1-イル	Me	H	5-Cl-ピリジン-2-イル
H	H	4-Cl-1H-イミダゾール-1-イル	Me	H	2-Cl-ピリジン-5-イル
H	H	5-CF ₃ -ピリジン-2-イル	Me	H	5-Cl-thien-2-イル
H	H	5-Cl-ピリジン-2-イル	H	COO-i-Pr	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
H	H	2-Cl-ピリジン-5-イル	H	CO-i-Pr	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
H	H	5-Cl-thien-2-イル	H	SO ₂ Me	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
Me	H	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル	H	SO ₂ Ph	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
Me	H	3-Br-1H-ピラゾール-1-イル	H	CO-t-Bu	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
Me	H	3-Me-1H-ピラゾール-1-イル			

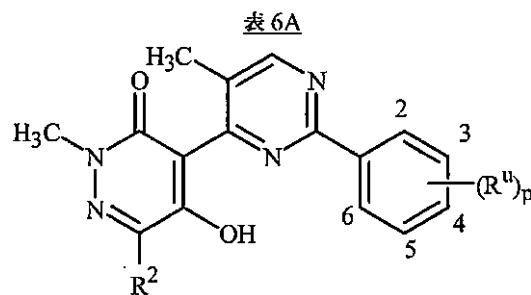
10

20

30

【 0 2 6 1 】

【表 2 3】

R²はH

10

(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p
4-F	4-Me	4-SOMe	4-Ph
4-Cl	4-Et	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-2-イル
4-Br	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₃	4-ピリジン-3-イル
4-I	4-C≡CH	4-SOCF ₂ H	4-ピリジン-4-イル
4-CF ₃	4-COMe	4-SO ₂ CF ₃	4-Thien-2-イル
4-CN	4-COCF ₃	4-SO ₂ CF ₂ H	4-SF ₅
4-NO ₂	4-COOMe	4-SO ₂ NH ₂	2-Cl
4-OH	4-CONH ₂	4-SO ₂ NMe ₂	3-Cl
4-OMe	4-CONHMe	4-SiMe ₃	2-F
4-OCF ₃	4-CONMe ₂	4-NH ₂	3-F
4-OCF ₂ H	4-OCOMe	4-NMe ₂	2,4-ジ-Cl
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-Cl
4-CHO	4-SCF ₃	4-NHCOOMe	3,4-ジ-F
4-CF ₂ H	4-SCF ₂ H	4-NHSO ₂ Me	

20

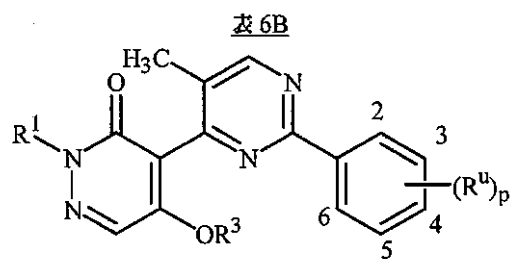
R²はCH₃

30

(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p
4-F	4-Me	4-SOMe	4-Ph
4-Cl	4-Et	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-2-イル
4-Br	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₃	4-ピリジン-3-イル
4-I	4-C≡CH	4-SOCF ₂ H	4-ピリジン-4-イル
4-CF ₃	4-COMe	4-SO ₂ CF ₃	4-Thien-2-イル
4-CN	4-COCF ₃	4-SO ₂ CF ₂ H	4-SF ₅
4-NO ₂	4-COOMe	4-SO ₂ NH ₂	2-Cl
4-OH	4-CONH ₂	4-SO ₂ NMe ₂	3-Cl
4-OMe	4-CONHMe	4-SiMe ₃	2-F
4-OCF ₃	4-CONMe ₂	4-NH ₂	3-F
4-OCF ₂ H	4-OCOMe	4-NMe ₂	2,4-ジ-Cl
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-Cl
4-CHO	4-SCF ₃	4-NHCOOMe	3,4-ジ-F
4-CF ₂ H	4-SCF ₂ H	4-NHSO ₂ Me	

40

【表 2 4】

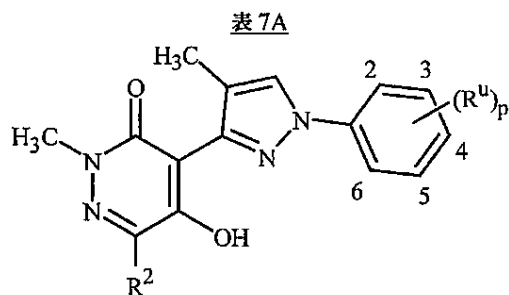


R^1	R^3	$(R^u)_p$	R^1	R^3	$(R^u)_p$
Me	COO-i-Pr	4-Cl	Me	COO-i-Pr	4-Me
Me	COO-i-Pr	4-Br	Et	H	4-Cl
Me	COO-i-Pr	4-F			
Me	COO-i-Pr	4-CF ₃			
Me	COO-i-Pr	4-OCF ₃			

10

【 0 2 6 3 】

【表 25】

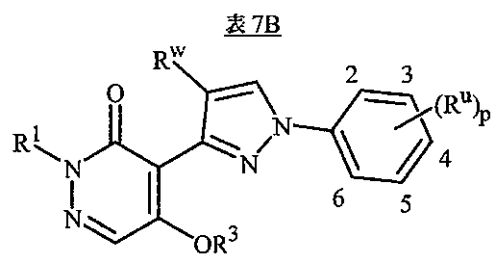
R²はH

(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p
4-F	4-Me	4-SOMe	4-Ph
4-Cl	4-Et	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-2-イル
4-Br	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₃	4-ピリジン-3-イル
4-I	4-C≡CH	4-SOCF ₂ H	4-ピリジン-4-イル
4-CF ₃	4-COMe	4-SO ₂ CF ₃	4-Thien-2-イル
4-CN	4-COCF ₃	4-SO ₂ CF ₂ H	4-SF ₅
4-NO ₂	4-COOMe	4-SO ₂ NH ₂	2-Cl
4-OH	4-CONH ₂	4-SO ₂ NMe ₂	3-Cl
4-OMe	4-CONHMe	4-SiMe ₃	2-F
4-OCF ₃	4-CONMe ₂	4-NH ₂	3-F
4-OCF ₂ H	4-OCOMe	4-NMe ₂	2,4-ジ-Cl
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-Cl
4-CHO	4-SCF ₃	4-NHCOOMe	3,4-ジ-F
4-CF ₂ H	4-SCF ₂ H	4-NHSO ₂ Me	

R²はCH₃

(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p
4-F	4-Et	4-SOCF ₃	4-ピリジン-4-イル
4-Cl	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₂ H	4-Thien-2-イル
4-Br	4-C≡CH	4-SO ₂ CF ₃	4-SF ₅
4-I	4-COMe	4-SO ₂ CF ₂ H	2-Cl
4-CF ₃	4-COCF ₃	4-SO ₂ NH ₂	3-Cl
4-CN	4-COOMe	4-SO ₂ NMe ₂	2-F
4-NO ₂	4-CONH ₂	4-SiMe ₃	3-F
4-OH	4-CONHMe	4-NH ₂	2,4-ジ-Cl
4-OMe	4-CONMe ₂	4-NMe ₂	3,4-ジ-Cl
4-OCF ₃	4-OCOMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-F
4-OCF ₂ H	4-SMe	4-NHCOOMe	
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SCF ₃	4-NHSO ₂ Me	
4-CHO	4-SCF ₂ H	4-Ph	
4-CF ₂ H	4-SOMe	4-ピリジン-2-イル	
4-Me	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-3-イル	

【表 2 6】



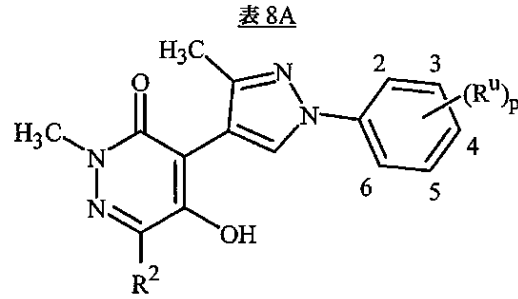
R ¹	R ³	R ^w	(R ^u) _p	R ¹	R ³	R ^w	(R ^u) _p
Me	H	Cl	4-Cl	Me	H	Cl	4-OCF ₂ CF ₂ H
Me	H	Br	4-Cl	Me	H	Cl	4-CHO
Me	H	Cl	4-F	Me	H	Cl	4-CF ₂ H
Me	H	Cl	4-Br	Me	H	Cl	4-Me
Me	H	Cl	4-CF ₃	Me	COO-i-Pr	Me	4-Cl
Me	H	Br	4-CF ₃	Me	COO-i-Pr	Me	4-Br
Me	H	Cl	4-CN	Me	COO-i-Pr	Me	4-F
Me	H	Cl	4-NO ₂	Me	COO-i-Pr	Me	4-CF ₃
Me	H	Cl	4-OMe	Me	COO-i-Pr	Me	4-OCF ₃
Me	H	Cl	4-OCF ₃	Me	COO-i-Pr	Me	4-Me
Me	H	Cl	4-OCF ₂ H	Et	H	Me	4-Cl

10

20

【 0 2 6 5 】

【表 27】

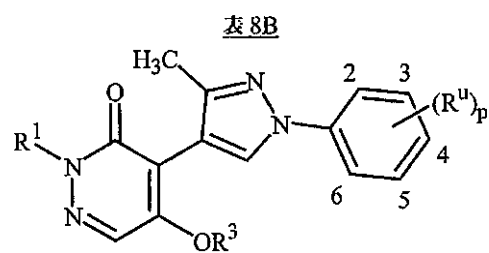
R²はH

(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p
4-F	4-Me	4-SOMe	4-Ph
4-Cl	4-Et	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-2-イル
4-Br	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₃	4-ピリジン-3-イル
4-I	4-C≡CH	4-SOCF ₂ H	4-ピリジン-4-イル
4-CF ₃	4-COMe	4-SO ₂ CF ₃	4-Thien-2-イル
4-CN	4-COCF ₃	4-SO ₂ CF ₂ H	4-SF ₅
4-NO ₂	4-COOMe	4-SO ₂ NH ₂	2-Cl
4-OH	4-CONH ₂	4-SO ₂ NMe ₂	3-Cl
4-OMe	4-CONHMe	4-SiMe ₃	2-F
4-OCF ₃	4-CONMe ₂	4-NH ₂	3-F
4-OCF ₂ H	4-OCOMe	4-NMe ₂	2,4-ジ-Cl
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-Cl
4-CHO	4-SCF ₃	4-NHCOOMe	3,4-ジ-F
4-CF ₂ H	4-SCF ₂ H	4-NHSO ₂ Me	

R²はCH₃

(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p
4-F	4-Me	4-SOMe	4-Ph
4-Cl	4-Et	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-2-イル
4-Br	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₃	4-ピリジン-3-イル
4-I	4-C≡CH	4-SOCF ₂ H	4-ピリジン-4-イル
4-CF ₃	4-COMe	4-SO ₂ CF ₃	4-Thien-2-イル
4-CN	4-COCF ₃	4-SO ₂ CF ₂ H	4-SF ₅
4-NO ₂	4-COOMe	4-SO ₂ NH ₂	2-Cl
4-OH	4-CONH ₂	4-SO ₂ NMe ₂	3-Cl
4-OMe	4-CONHMe	4-SiMe ₃	2-F
4-OCF ₃	4-CONMe ₂	4-NH ₂	3-F
4-OCF ₂ H	4-OCOMe	4-NMe ₂	2,4-ジ-Cl
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-Cl
4-CHO	4-SCF ₃	4-NHCOOMe	3,4-ジ-F
4-CF ₂ H	4-SCF ₂ H	4-NHSO ₂ Me	

【表 2 8】

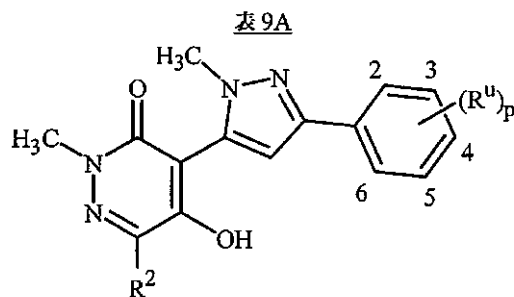


10

R ¹	R ³	(R ^u) _p	R ¹	R ³	(R ^u) _p
Me	COO-i-Pr	4-Cl	Me	COO-i-Pr	4-OCF ₃
Me	COO-i-Pr	4-Br	Me	COO-i-Pr	4-Me
Me	COO-i-Pr	4-F	Et	H	4-Cl
Me	COO-i-Pr	4-CF ₃			

【 0 2 6 7 】

【表 29】

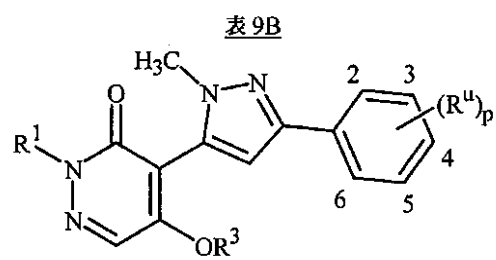
R²はH

(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p
4-F	4-Me	4-SOMe	4-Ph
4-Cl	4-Et	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-2-イル
4-Br	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₃	4-ピリジン-3-イル
4-I	4-C≡CH	4-SOCF ₂ H	4-ピリジン-4-イル
4-CF ₃	4-COMe	4-SO ₂ CF ₃	4-Thien-2-イル
4-CN	4-COCF ₃	4-SO ₂ CF ₂ H	4-SF ₅
4-NO ₂	4-COOMe	4-SO ₂ NH ₂	2-Cl
4-OH	4-CONH ₂	4-SO ₂ NMe ₂	3-Cl
4-OMe	4-CONHMe	4-SiMe ₃	2-F
4-OCF ₃	4-CONMe ₂	4-NH ₂	3-F
4-OCF ₂ H	4-OCOMe	4-NMe ₂	2,4-ジ-Cl
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-Cl
4-CHO	4-SCF ₃	4-NHCOOMe	3,4-ジ-F
4-CF ₂ H	4-SCF ₂ H	4-NHSO ₂ Me	

R²はCH₃

(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p	(R ^u) _p
4-F	4-Me	4-SOMe	4-Ph
4-Cl	4-Et	4-SO ₂ Me	4-ピリジン-2-イル
4-Br	4-CH=CH ₂	4-SOCF ₃	4-ピリジン-3-イル
4-I	4-C≡CH	4-SOCF ₂ H	4-ピリジン-4-イル
4-CF ₃	4-COMe	4-SO ₂ CF ₃	4-Thien-2-イル
4-CN	4-COCF ₃	4-SO ₂ CF ₂ H	4-SF ₅
4-NO ₂	4-COOMe	4-SO ₂ NH ₂	2-Cl
4-OH	4-CONH ₂	4-SO ₂ NMe ₂	3-Cl
4-OMe	4-CONHMe	4-SiMe ₃	2-F
4-OCF ₃	4-CONMe ₂	4-NH ₂	3-F
4-OCF ₂ H	4-OCOMe	4-NMe ₂	2,4-ジ-Cl
4-OCF ₂ CF ₂ H	4-SMe	4-NHCOMe	3,4-ジ-Cl
4-CHO	4-SCF ₃	4-NHCOOMe	3,4-ジ-F
4-CF ₂ H	4-SCF ₂ H	4-NHSO ₂ Me	

【表 3 0】

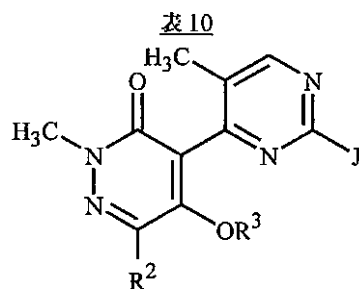


R ¹	R ³	(R ^u) _p	R ¹	R ³	(R ^u) _p
Me	COO-i-Pr	4-Cl	Me	COO-i-Pr	4-OCF ₃
Me	COO-i-Pr	4-Br	Me	COO-i-Pr	4-Me
Me	COO-i-Pr	4-F	Et	H	4-Cl
Me	COO-i-Pr	4-CF ₃			

10

【 0 2 6 9 】

【表 3 1】



R ²	R ³	J	R ²	R ³	J
H	H	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	3-Cl-1H-ピラゾール-1-イル
H	H	3-Br-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	4-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
H	H	3-Me-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	4-Br-1H-ピラゾール-1-イル
H	H	3-Cl-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	4-Me-1H-ピラゾール-1-イル
H	H	4-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	4-Cl-1H-ピラゾール-1-イル
H	H	4-Br-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	4-CN-1H-ピラゾール-1-イル
H	H	4-Me-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	3-Me-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
H	H	4-Cl-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	3-Br-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
H	H	4-CN-1H-ピラゾール-1-イル	Me	H	3-CF ₃ -1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
H	H	3-Me-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル	Me	H	4-CF ₃ -1H-イミダゾール-1-イル
H	H	3-Br-1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル	Me	H	4-Me-1H-イミダゾール-1-イル
H	H	3-CF ₃ -1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル	Me	H	4-Cl-1H-イミダゾール-1-イル
H	H	4-CF ₃ -1H-イミダゾール-1-イル	Me	H	5-CF ₃ -ピリジン-2-イル
H	H	4-Me-1H-イミダゾール-1-イル	Me	H	5-Cl-ピリジン-2-イル
H	H	4-Cl-1H-イミダゾール-1-イル	Me	H	2-Cl-ピリジン-5-イル
H	H	5-CF ₃ -ピリジン-2-イル	Me	H	5-Cl-thien-2-イル
H	H	5-Cl-ピリジン-2-イル	H	COO-i-Pr	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
H	H	2-Cl-ピリジン-5-イル	H	CO-i-Pr	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
H	H	5-Cl-thien-2-イル	H	SO ₂ Me	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
Me	H	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル	H	SO ₂ Ph	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
Me	H	3-Br-1H-ピラゾール-1-イル	H	CO-t-Bu	3-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
Me	H	3-Me-1H-ピラゾール-1-イル			

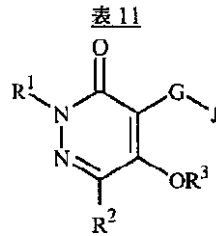
10

20

30

【 0 2 7 0 】

【表 3 2】



R ¹	R ²	R ³	G	J
Me	H	H	1,2,4-チアジアゾール-5-イル	3-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	1,2,4-オキサジアゾール-5-イル	3-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	イソキサゾール-5-イル	3-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	イソキサゾール-3-イル	5-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	イソチアゾール-5-イル	3-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	イソチアゾール-3-イル	5-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	5-Me-2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル	2-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	1,3,4-チアジアゾール-2-イル	5-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	1,3,4-チアジアゾール-5-イル	2-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	1,3,5-チアジアゾール-2-イル	4-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	1,3,5-チアジアゾール-4-イル	2-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	1,3,4-オキサジアゾール-2-イル	5-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	1,3,4-オキサジアゾール-5-イル	2-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	1,3,5-オキサジアゾール-2-イル	4-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	1,3,5-オキサジアゾール-4-イル	2-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	チアゾール-2-イル	5-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	チアゾール-2-イル	4-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	5-Me-チアゾール-4-イル	2-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	オキサゾール-2-イル	5-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	オキサゾール-2-イル	4-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	5-Me-オキサゾール-4-イル	2-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	4-Me-オキサゾール-5-イル	2-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	1,2,4-トリアジン-3-イル	5-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	6-Me-1,2,4-トリアジン-5-イル	3-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	1,3,5-トリアジン-2-イル	4-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	3-Me-ピリジン-2-イル	6-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	2-Me-ピリジン-3-イル	5-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	3-Cl-ピリジン-2-イル	4-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	5-Me-ピリジン-4-イル	2-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	2-Me-ピラジン-3-イル	5-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	3-Me-ピリダジン-4-イル	6-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	3-Cl-ピリダジン-4-イル	6-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	ピリミジン-2-イル	4-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	3-Me-thien-2-イル	5-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	2-Me-thien-3-イル	5-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	3-Me-フラン-2-イル	5-(4-クロロフェニル)
Me	H	H	2-Me-フラン-3-イル	5-(4-クロロフェニル)
Me	Me	H	5-Me-2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル	2-(4-クロロフェニル)
Me	H	COO-i-Pr	5-Me-2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル	2-(4-クロロフェニル)
Me	Me	H	6-Me-1,2,4-トリアジン-5-イル	3-(4-クロロフェニル)
Me	H	SO ₂ Me	6-Me-1,2,4-トリアジン-5-イル	3-(4-クロロフェニル)
Me	Me	H	5-Me-オキサゾール-4-イル	2-(4-クロロフェニル)
Me	H	CO-t-Bu	5-Me-オキサゾール-4-イル	2-(4-クロロフェニル)
Et	H	H	5-Me-2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル	2-(4-クロロフェニル)

10

20

30

40

配合 / 実用性

本発明の式 1 の化合物は、一般に、キャリアとなる、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の追加の構成成分との組成物、すなわち配合物中において、除草性有効成分として用いられることとなる。配合成分または組成成分は、活性成分の物理特性、用途形態、ならびに土壌タイプ、水分および温度などの環境因子と適応するよう選択される。

【 0 2 7 2 】

有用な配合物としては液体および固体組成物の両方を含む。液体組成物の例としては、溶液（乳化性濃縮物を含む）、懸濁液、エマルジョン（マイクロエマルジョンおよび / またはサスポエマルジョンを含む）等などが挙げられ、これは、任意によりゲルに濃縮されることが可能である。水性液体組成物の一般的なタイプは、可溶性濃縮物、懸濁濃縮物、カプセル懸濁液、濃縮エマルジョン、マイクロエマルジョンおよびサスポ - エマルジョンである。非水性液体組成物の一般的なタイプは、乳化性濃縮物、マイクロ乳化性濃縮物、分散性濃縮物および油分散体である。

10

【 0 2 7 3 】

固体組成物の一般的なタイプは、水分散性（「水和性」）または水溶性であることが可能である、ダスト、粉末、顆粒、ペレット、ブリル、パステル剤、タブレット、充填フィルム（種子コーティングを含む）等である。フィルム形成性溶液または流動性懸濁液から形成されたフィルムおよびコーティングは、種子処理のために特に有用である。活性成分は、（マイクロ）カプセル化され、さらに、懸濁液または固体配合物に形成されることが可能であり；あるいは、活性成分の全配合物がカプセル化（または「オーバーコート化」）されることが可能である。カプセル化は、活性成分の放出を、制御または遅延させることが可能である。乳化性顆粒は、乳化性濃縮配合物および乾燥顆粒状配合物の両方の利点を組み合わせる。高強度組成物は、主に、さらなる配合物用の中間体として用いられる。

20

【 0 2 7 4 】

噴霧可能な配合物は、典型的には、吹付け前に好適な媒体中に希釈される。このような液体および固体配合物は、噴霧媒体、通常は水中に容易に希釈されるよう処方される。噴霧体積は、約一〜数千リットル／ヘクタールの範囲であることが可能であるが、より典型的には、約十〜数百リットル／ヘクタールの範囲である。噴霧可能な配合物は、空中散布または地上散布による葉処理のために、または植物の成長媒体への適用のために、タンク中で水または他の好適な媒体と混合されることが可能である。液体および乾燥配合物は、点滴灌漑システムに直接的に計量され、または定植中に畝間に計量されることが可能である。

30

【 0 2 7 5 】

配合物は、典型的には、合計で 1 0 0 重量パーセントとなる以下のおよその範囲内で、有効量の活性成分、希釈剤および界面活性剤を含有するであろう。

【 0 2 7 6 】

【表 3 3】

	重量パーセント		
	有効成分	希釈剤	界面活性剤
水分散性および水溶性顆粒、錠剤および粉末	0.001~90	0~99.999	0~15
油分散体、懸濁液、エマルジョン、溶液(乳化性濃縮物を含む)	1~50	40~99	0~50
粉剤	1~25	70~99	0~5
顆粒およびベレット	0.001~99	5~99.999	0~15
高濃度組成物	90~99	0~10	0~2

10

【0277】

固体希釈剤としては、例えば、ベントナイト、モンモリロナイト、アタパルジャイトおよびカオリンなどの粘土、石膏、セルロース、二酸化チタン、酸化亜鉛、スターチ、デキストリン、糖質（例えば、ラクトース、スクロース）、シリカ、タルク、雲母、珪藻土、尿素、炭酸カルシウム、炭酸ナトリウムおよび重炭酸ナトリウム、および硫酸ナトリウムが挙げられる。典型的な固体希釈剤が、Watkinsら、「Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers」、第2版、Dorland Books、Caldwell, New Jerseyに記載されている。

20

【0278】

液体希釈剤としては、例えば、水、N,N-ジメチルアルカンアミド（例えば、N,N-ジメチルホルムアミド）、リモネン、ジメチルスルホキシド、N-アルキルピロリドン（例えば、N-メチルピロリジノン）、エチレングリコール、トリエチレングリコール、プロピレングリコール、ジプロピレングリコール、ポリプロピレングリコール、プロピレンカーボネート、ブチレンカーボネート、パラフィン（例えば、白色鉱油、正パラフィン、イソパラフィン）、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、グリセリン、グリセロールトリアセテート、ソルビトール、トリアセチン、芳香族炭化水素、脱芳香族脂肪族化合物、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン；シクロヘキサノン、2-ヘプタノン、イソホロンおよび4-ヒドロキシ-4-メチル-2-ペンタノンなどのケトン；イソアミルアセテート、ヘキシルアセテート、ヘプチルアセテート、オクチルアセテート、ノニルアセテート、トリデシルアセテートおよびイソボルニルアセテートなどの酢酸塩；アルキル化乳酸塩エステル、二塩基性エステルおよびγ-ブチrolaktonなどの他のエステル；ならびに、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロピルアルコール、n-ブタノール、イソブチルアルコール、n-ヘキサノール、2-エチルヘキサノール、n-オクタノール、デカノール、イソデシルアルコール、イソオクタデカノール、セチルアルコール、ラウリルアルコール、トリデシルアルコール、オレイルアルコール、シクロヘキサノール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ジアセトンアルコールおよびベンジルアルコールなどの直鎖、分岐、飽和または不飽和であることが可能であるアルコールが挙げられる。液体希釈剤としてはまた、植物シードおよび果実油（例えば、オリーブ油、ヒマシ油、亜麻仁油、ゴマ油、コーン（トウモロコシ）油、ピーナッツ油、ヒマワリ油、グレープシード油、ベニバナ油、綿実油、ダイズ油、菜種油、ココナッツおよびパームナッツ油）、動物性脂肪（例えば、牛脂、豚脂、ラード、タラ肝油、魚油）、およびこれらの混合物などの、飽和および不飽和脂肪酸のグリセロールエステル（典型的にはC₆~C₂₂）が挙げられる。液体希釈剤としてはまたアルキル化脂肪酸（例えば、メチル化、エチル化、ブチル化）が挙げられ、ここで、脂肪酸は、植物性および動物性のグリセロールエステル

30

40

50

の加水分解により入手し得、蒸留により精製することが可能である。典型的な液体希釈剤が、Marsden、「Solvents Guide」、第2版、Interscience、New York、1950年に記載されている。

【0279】

本発明の固体および液体組成物は、度々、1種以上の界面活性剤を含む。液体に添加されるとき、界面活性剤（「表面活性剤」としても公知である）は、一般に、液体の表面張力を変性、ほとんどの場合低減させる。界面活性剤分子における親水性基および親油性基の性質に応じて、界面活性剤は、湿潤剤、分散剤、乳化剤または消泡剤として有用であることが可能である。

【0280】

界面活性剤は、ノニオン性、アニオン性またはカチオン性に分類することが可能である。本発明の組成物に有用なノニオン性界面活性剤としては、これらに限定されないが：天然および合成アルコール（分岐または直鎖であり得る）ベースのアルコールアルコキシレートなどの、アルコールおよびエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはこれらの混合物から調製されるアルコールアルコキシレート；アミンエトキシレート、アルカノールアミドおよびエトキシル化アルカノールアミド；エトキシル化ダイズ、ヒマシ油および菜種油などのアルコキシ化トリグリセリド；オクチルフェノールエトキシレート、ノニルフェノールエトキシレート、ジノニルフェノールエトキシレートおよびドデシルフェノールエトキシレートなどのアルキルフェノールアルコキシレート（フェノールおよびエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはこれらの混合物から調製される）；エチレンオキシドまたはプロピレンオキシドおよび末端ブロックがプロピレンオキシドから調製される逆ブロックポリマーから調製されるブロックポリマー；エトキシル化脂肪酸；エトキシル化脂肪酸エステルおよび油；エトキシル化メチルエステル；エトキシル化トリステアシルフェノール（エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはこれらの混合物から調製されるものを含む）；ポリエトキシル化ソルビタン脂肪酸エステル、ポリエトキシル化ソルビトール脂肪酸エステルおよびポリエトキシル化グリセロール脂肪酸エステルなどの、脂肪酸エステル、グリセロールエステル、ラノリン - ベースの誘導体、ポリエトキシレートエステル；ソルビタンエステルなどの他のソルビタン誘導体；ランダムコポリマー、ブロックコポリマー、アルキドPEG（ポリエチレングリコール）樹脂、グラフトポリマーまたはくし形ポリマーおよび星形ポリマーなどの高分子界面活性剤；ポリエチレングリコール（PEG）；ポリエチレングリコール脂肪酸エステル；シリコーン - ベースの界面活性剤；およびスクロースエステル、アルキルポリグリコシドおよびアルキル多糖類などの糖質 - 誘導体が挙げられる。

【0281】

有用なアニオン性界面活性剤としては、これらに限定されないが：アルキルアリアルスルホン酸およびこれらの塩；カルボキシル化アルコールまたはアルキルフェノールエトキシレート；ジフェニルスルホネート誘導体；リグノスルホネートなどのリグニンおよびリグニン誘導体；マレイン酸またはコハク酸またはこれらの無水物；オレフィンスルホン酸塩；アルコールアルコキシレートのリン酸エステル、アルキルフェノールアルコキシレートのリン酸エステルおよびステアシルフェノールエトキシレートのリン酸エステルなどのリン酸エステル；タンパク質 - ベースの界面活性剤；サルコシン誘導体；ステアシルフェノールエーテル硫酸；油および脂肪酸の硫酸塩およびスルホン酸塩；エトキシル化アルキルフェノールの硫酸塩およびスルホン酸塩；アルコールの硫酸塩；エトキシル化アルコールの硫酸塩；N,N - アルキルタウレートなどのアミンおよびアミドのスルホン酸塩；ベンゼン、クメン、トルエン、キシレン、およびドデシルおよびトリデシルベンゼンのスルホン酸塩；縮合ナフタレンのスルホン酸塩；ナフタレンおよびアルキルナフタレンのスルホン酸塩；精留された石油のスルホン酸塩；スルホスクシナメート（sulfosuccinamate）；およびジアルキルスルホコハク酸塩などのスルホコハク酸塩およびそれらの誘導体が挙げられる。

【0282】

有用なカチオン性界面活性剤としては、これらに限定されないが：アミドおよびエトキシシル化アミド；N - アルキルプロパンジアミン、トリプロピレントリアミンおよびジプロピレン - テトラアミン、およびエトキシシル化アミン、エトキシシル化ジアミンおよびプロボキシ化アミンなどのアミン（アミンおよびエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはこれらの混合物から調製される）；アミン酢酸塩およびジアミン塩などのアミン塩；第4級塩、エトキシシル化第4級塩および二第4級塩などの第4級アンモニウム塩；およびアルキルジメチルアミンオキシドおよびビス - （2 - ヒドロキシエチル） - アルキルアミンオキシドなどのアミンオキシドが挙げられる。

【0283】

ノニオン性およびアニオン性界面活性剤の混合物またはノニオン性およびカチオン性界面活性剤の混合物がまた本発明の組成物に有用である。ノニオン性、アニオン性およびカチオン性界面活性剤およびそれらの推奨される使用法は、McCutcheon's Division、The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 発行のMcCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual、年鑑米国版および国際版；SiselyおよびWood、「Encyclopedia of Surface Active Agents」、Chemical Publ. Co., Inc., New York、1964年；およびA. S. DavidsonおよびB. Milwidsky、「Synthetic Detergents」、第7版、John Wiley and Sons、New York、1987年を含む多様な刊行された文献中に開示されている。

10

20

【0284】

本発明の組成物はまた、当業者に配合補助剤として公知である配合助剤および添加剤を含有し得る（これらのいくつかは、固体希釈剤、液体希釈剤または界面活性剤としても機能するとみなされ得る）。このような配合助剤および添加剤は：pH（緩衝）、工程中の発泡（ポリオルガノシロキサンなどの消泡剤）、活性成分の沈降（懸濁剤）、粘度（チクソトロピー性増粘剤）、容器中での微生物の増殖（抗菌剤）、生成物の凍結（不凍剤）、色（染料／顔料分散体）、洗浄（塗膜形成剤または粘着剤）、蒸発（蒸発抑制剤）、および他の配合特質を制御し得る。塗膜形成剤としては、例えば、ポリ酢酸ビニル、ポリ酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルピロリドン - 酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルアルコール、ポリビニルアルコールコポリマーおよびワックスが挙げられる。配合助剤および添加剤の例としては、McCutcheon's Division、The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 発行のMcCutcheon第2巻：McCutcheon's Volume 2：Functional Materials、年鑑国際版および北米版；および国際公開第03/024222号パンフレットに記載のものが挙げられる。

30

【0285】

式1の化合物およびいずれかの他の活性成分は、典型的には、活性成分を溶剤中に溶解させることにより、または液体または乾燥希釈剤中に粉碎することにより本発明の組成物に組み込まれる。乳化性濃縮物を含む溶液は、単に成分を混合することにより調製されることが可能である。乳化性濃縮物として用いられることが意図された液体組成物の溶剤が水 - 不混和性である場合には、典型的には、乳化剤が、活性剤含有溶剤を水での希釈時に乳化させるよう添加される。2,000 μm 以下の粒径を有する活性成分スラリーは、媒体ミルを用いる湿式ミルにかけられて、3 μm 未満の平均直径を有する粒子を得ることが可能である。水性スラリーは、最終懸濁液濃縮物に形成されることが可能であり（例えば、米国特許第3,060,084号明細書を参照のこと）、または噴霧乾燥によりさらに処理されて水 - 分散性顆粒を形成することが可能である。乾燥配合物は、通常は、2 ~ 10 μm の範囲に平均粒径をもたらす乾燥ミルプロセスを必要とする。ダストおよび粉末は、ブレンダー、および通常は粉碎する（ハンマーミルまたは流体 - エネルギーミルなどで）ことにより調製されることが可能である。顆粒およびペレットは、あらかじめ形成された

40

50

顆粒状キャリアへの活性材料の吹付け、または凝塊技術により調製されることが可能である。Browning、「Agglomeration」、Chemical Engineering、1967年12月4日、147～48頁、「Perry's Chemical Engineer's Handbook」、第4版、McGraw-Hill、New York、1963年、8～57頁および以降、ならびに国際公開第91/13546号パンフレットを参照のこと。ペレットは、米国特許第4,172,714号明細書に記載のとおり調製されることが可能である。水-分散性および水溶性顆粒は、米国特許第4,144,050号明細書、米国特許第3,920,442号明細書および独国特許第3,246,493号明細書に教示のとおり調製されることが可能である。タブレットは、米国特許第5,180,587号明細書、米国特許第5,232,701号明細書および米国特許第5,208,030号明細書に教示のとおり調製されることが可能である。フィルムは、英国特許第2,095,558号明細書および米国特許第3,299,566号明細書に教示のとおり調製されることが可能である。

10

20

30

【0286】

配合物の技術分野に関するさらなる情報については、「Pesticide Chemistry and Bioscience、The Food-Environment Challenge」、T. BrooksおよびT. R. Roberts編、第9回有害生物防除剤化学国際会議の予稿集、The Royal Society of Chemistry、Cambridge、1999年、120～133頁における、Woods、「Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture」を参照のこと。米国特許第3,235,361号明細書、第6欄、第16行から第7欄、第19行および実施例10～41；米国特許第3,309,192号明細書、第5欄、第43行から第7欄、第62行および実施例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138～140、162～164、166、167および169～182；米国特許第2,891,855号明細書、第3欄、第66行から第5欄、第17行および実施例1～4；Klingman、「Weed Control as a Science」、John Wiley and Sons, Inc.、New York、1961年、81～96頁；Hancera、「Weed Control Handbook」、第8版、Blackwell Scientific Publications、Oxford、1989年；なら

【0287】

以下の実施例においては、すべての割合は重量当たりであり、すべての配合物は従来の方法で調製される。化合物番号は、索引表A～B中の化合物を指す。さらなる加工無しで、上記の記載を用いる当業者は、本発明を最大限利用することが可能であると考えられている。以下の実施例は、従って、単に例示的であると解釈されるべきであり、如何様にも開示を制限しない。割合は、そうでないと明示されている場合を除き重量当たりである。

【0288】

【表34】

40

実施例A

高濃度濃縮物

化合物1	98.5%
シリカエアロゲル	0.5%
合成アモルファス微細シリカ	1.0%

【0289】

50

【表 3 5】

実施例 B水和剤

化合物 2	65.0%	
ドデシルフェノールポリエチレングリコールエーテル	2.0%	
リグニンスルホン酸ナトリウム	4.0%	
アルミノケイ酸ナトリウム	6.0%	
モンモリロナイト(焼成済)	23.0%	10

【0 2 9 0】

【表 3 6】

実施例 C顆粒

化合物 3	10.0%	
アタパルジャイト顆粒(低揮発性物質、0.71/0.30 mm; U.S.S. No. 25~50 シーブ)	90.0%	20

【0 2 9 1】

【表 3 7】

実施例 D押出ペレット

化合物 4	25.0%	
無水硫酸ナトリウム	10.0%	
粗リグニンスルホン酸カルシウム	5.0%	
アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム	1.0%	30
カルシウム/マグネシウムベントナイト	59.0%	

【0 2 9 2】

【表 3 8】

実施例 E乳化性濃縮物

化合物 5	10.0%	
ポリオキシエチレンソルビトールヘキサオレエート	20.0%	
C ₆ ~C ₁₀ 脂肪酸メチルエステル	70.0%	40

【0 2 9 3】

【表 3 9】

実施例 F

マイクロエマルジョン

化合物 6	5.0%
ポリビニルピロリドン-ビニルアセテートコポリマー	30.0%
アルキルポリグリコシド	30.0%
グリセリルモノオレエート	15.0%
水	20.0%

10

【0294】

テスト結果は、本発明の化合物は、高度に有効な発芽前および／あるいは発芽後除草剤、ならびに／または、植物成長調節剤であることを示す。これらの多くは、燃料保管タンクの周辺、工業用保管領域、駐車場、ドライブインシアター、飛行場、河岸、灌漑および他の水路、広告板および幹線道路の周辺、ならびに、鉄道構造などの、すべての植生の完全な防除が所望される領域において、幅広い範囲の出芽前および／または出芽後雑草防除に対する実用性を有する。本発明の化合物の多くは、作物対雑草における選択的な代謝のため、または、作物および雑草における生理学的障害部位での選択的な活性により、または、作物と雑草との混合物の環境に対する、もしくは、その中での選択的な配置により、作物／雑草混合物におけるイネ科雑草および広葉雑草の選択的な防除のために有用である。当業者は、化合物または化合物の群におけるこれらの選択性要素の好ましい組み合わせは、ルーチ的な生物学的および／または生化学的アッセイを実施することにより容易に判定可能であることを認識するであろう。本発明の化合物は、特にこれらに限定されないが、アルファルファ、オオムギ、綿、コムギ、セイヨウアブラナ、サトウダイコン、コーン（トウモロコシ）、モロコシ、ダイズ、イネ、カラスムギ、ピーナッツ、野菜、トマト、ジャガイモを含む重要な農耕作物；コーヒー、カカオ、アブラヤシ、ゴム、サトウキビ、柑橘類、ブドウ、果実樹、堅果の成る木、バナナ、オオバコ、パイナップル、ホップ、茶を含む多年生プランテーション作物；ならびに、ユーカリ属および針葉樹（例えば、タエダマツ）などの森林、および芝生種（例えば、ケンタッキーブルーグラス、アメリカシバ、ケンタッキーフェスクおよびパミュダグラス）に対する許容範囲を示し得る。本発明の化合物は、コーン、イネ（陸稲および水稲の両方）、ダイズおよびコムギの作物における選択的な雑草防除に対して特に有用である。本発明の化合物は、除草剤に対する耐性が組み込まれるよう遺伝的に形質転換されたまたは育種された、無脊椎有害生物に有害なタンパク質を発現する（パチルスチューリンゲンシス（*Bacillus thuringiensis*）毒素など）、および／または、他の有用な特質を発現する作物において用いられることが可能である。当業者は、すべての化合物が、すべての雑草に対して等しく有効であるわけでないことを認識するであろう。代わりに、本化合物は、植物の成長を改変させるのに有用である。

20

30

【0295】

本発明の化合物は発芽前および発芽後除草活性の両方を有しているため、植生を死滅させるか害を与えることにより、または、その生長を低減させることにより望ましくない植生を防除するために、この化合物は、除草的に有効な量の本発明の化合物、または、前記化合物を含む組成物、および、界面活性剤、固体希釈剤または液体希釈剤の少なくとも１種を、望ましくない植生の群葉もしくは他の部分に、または、望ましくない植生が生長しているかもしくは望ましくない植生の種子あるいは他の栄養繁殖体を囲んでいる土壌もしくは水などの望ましくない植生の環境に接触させる工程を含む多様な方法によって有用に適用されることが可能である。

40

【0296】

本発明の化合物の除草的に有効な量は、多数の要因によって判定される。これらの要因としては：選択された配合物、適用方法、存在する植生の量およびタイプ、成長条件等が

50

挙げられる。普通、本発明の化合物の除草的に有効な量は、約 0.0001 ~ 20 kg / ha であって、好ましい範囲は約 0.001 ~ 5 kg / ha であり、より好ましい範囲は約 0.004 ~ 3 kg / ha である。当業者は、所望のレベルの雑草防除のために必要な除草的に有効な量を容易に判定することが可能である。

【0297】

本発明の化合物はまた、除草剤、薬害軽減剤、殺菌・殺カビ剤、殺虫剤、抗線虫薬、殺菌剤、殺ダニ剤、昆虫脱皮阻害剤および発根促進剤などの成長調整剤、不妊化剤、信号化学物質、忌避剤、誘引剤、フェロモン、摂食刺激物質、植物栄養分、他の生物学的に有効な成分、または、昆虫病原性バクテリア、ウイルスあるいは真菌を含む 1 種以上の他の生物学的に有効な成分または薬剤と混合されて、さらに広い範囲の農学的保護をもたらす多成分有害生物防除剤を形成することが可能である。本発明の化合物と他の除草剤との混合物は、追加の雑草種に対する有効範囲を広げること、および、いずれかの耐性の生物型の増殖を抑制することが可能である。それ故、本発明はまた、除草的に有効な量の式 1 の化合物および生物学的に有効な量の少なくとも 1 種の追加の生物学的に有効な成分または薬剤を含むと共に、界面活性剤、固体希釈剤または液体希釈剤の少なくとも 1 種をさらに含むことが可能である組成物に関する。他の生物学的に有効な成分または薬剤は、界面活性剤、固体または液体希釈剤の少なくとも 1 種を含む組成物中に配合されることが可能である。本発明の混合物について、1 種以上の他の生物学的に有効な成分あるいは薬剤は、式 1 の化合物と一緒に配合されてプレミックスを形成することが可能であり、または、1 種以上の他の生物学的に有効な成分あるいは薬剤は、式 1 の化合物とは個別に配合されると共に、配合物が適用前に一緒に組み合わせられる（例えば、噴霧タンク中で）か、あるいは、代替的に、順次に適用されることが可能である。

【0298】

以下の除草剤の 1 種以上と本発明の化合物との混合物が雑草防除に特に有用であり得る：アセトクロール、アシフルオルフェンおよびそのナトリウム塩、アクロニフェン、アクロレイン（2 - プロペナル）、アラクロール、アロキシジム、アメトリン、アミカルバゾン、アミドスルフロン、アミノシクロピラクロールおよびそのエステル（例えば、メチル、エチル）および塩（例えば、ナトリウム、カリウム）、アミノピラリド、アミトロール、スルファミド酸アンモニウム、アニロホス、アシュラム、アトラジン、アジムスルフロン、ベフルブタミド、ベナゾリン、ベナゾリン - エチル、ベンカルバゾン、ベンフルラリン、ベンフレセート、ベンスルフロン - メチル、ベンスリド、ベントゾン、ベンゾピシクロン、ベンゾフェナップ、ピフェノックス、ピラナホス、ビスピリバックおよびそのナトリウム塩、プロマシル、プロモブチド、プロモフェノキシム、プロモキシニル、オクタン酸プロモキシニル、ブタクロール、ブタフェナシル、ブタミホス、ブトラリン、ブトロキシジム、ブチレート、カフェンストロール、カルベタミド、カルフェントラゾン - エチル、カテキン、クロメトキシフェン、クロラムベン、クロルプロムロン、クロルフルレノール - メチル、クロリダゾン、クロリムロン - エチル、クロロトルロン、クロルプロファミン、クロルスルフロン、クロルタール - ジメチル、クロルチアミド、シニドン - エチル、シンメチリン、シノスルフロン、クレホキシジム、クレトジム、クロジナホップ - プロパルギル、クロマゾン、クロメプロップ、クロピラリド、クロピラリド - オルアミン、クロランスラム - メチル、クミルロン、シアナジン、シクロエート、シクロスルファミン、シクロキシジム、シハロホップ - ブチル、2, 4 - D およびそのブトチル、ブチル、イソオクチルおよびイソプロピルエステルおよびそのジメチルアンモニウム、ジオラミンおよびトロールアミン塩、ダイムロン、ダラボン、ダラボン - ナトリウム、ダゾメット、2, 4 - DB およびそのジメチルアンモニウム、カリウムおよびナトリウム塩、デスメディファミン、デスメトリン、ジカンバおよびそのジグリコールアンモニウム、ジメチルアンモニウム、カリウムおよびナトリウム塩、ジクロベニル、ジクロルプロップ、ジクロホップ - メチル、ジクロスラム、ジフェンゾコートメチル硫酸塩、ジフルヘニカン、ジフルフェンゾピル、ジメフロン、ジメピペレート、ジメタクロール、ジメタメトリン、ジメテナミド、ジメテナミド - P、ジメチピン、ジメチルアルシン酸およびそのナトリウム塩、ジニトロ

アミン、ジノテルブ、ジフェナミド、ダイコートジプロミド、ジチオビル、ジウロン、D
 N O C、エンドタール、E P T C、エスプロカルブ、エタルフルラリン、エタメツルフロ
 ン - メチル、エチオジン、エトフメセート、エトキシフェン、エトキシスルフロ
 ン、エト
 ベンザニド、フェノキサプロップ - エチル、フェノキサプロップ - P - エチル、フェント
 ラザミド、フェヌロン、フェヌロン - T C A、フラムプロップ - メチル、フラムプロップ
 - M - イソプロピル、フラムプロップ - M - メチル、フラザスルフロ
 ン、フロラ
 スラム、フルアジホップ - ブチル、フルアジホップ - P - ブチル、フルカルバゾン、フルセトスル
 フロン、フルクロラリン、フルフェナセット、フルフェンビル、フルフェンビル - エチル
 、フルアゾ
 レート、フルメツラム、フルミクロラック - ペンチル、フルミオキサジン、フル
 オメツロ
 ン、フルオログリコフェンエチル、フルボキサム、フルビルスルフロ
 ン - メチル
 およびそのナトリウム塩、フルレノール、フルレノール - ブチル、フルリドン、フルロ
 クロリ
 ドン、フルロキシビル、フルルタモン、フルチアセット - メチル、フォメサフェン
 、ホラム
 スルフロ
 ン、ホサミン - アンモニウム、グルホシネート、グルホシネート - アン
 モニウム、
 グリホサートならびにアンモニウム、イソプロピルアンモニウム、カリウム、
 ナトリウ
 ム (セスキナトリウム塩を含む) およびトリメシウム塩 (あるいはスルホサート
 と呼ばれる) などのその塩、ハロスルフロ
 ン - メチル、ハロキシホップ - エチル、ハロ
 キシホッ
 プ - メチル、ヘキサジノン、イマザメタベンズ - メチル、イマザモックス、イマ
 ザピック、
 イマザビル、イマザキン、イマザキン - アンモニウム、イマゼタビル、イマゼ
 タビル - アン
 モニウム、イマゾスルフロ
 ン、インダノファン、イオドスルフロ
 ン - メチル
 、アイオキシ
 ニル、アイオキシニルオクタン酸、アイオキシニル - ナトリウム、イソプロ
 ツロ
 ン、イソウ
 ロン、イソキサベン、イソキサフルトール、イソキサクロルトール、ラク
 トフェン、
 レナシル、リニュロン、マレイン酸ヒドラジド、M C P A およびそのジメチル
 アンモニ
 ウム、カリウムおよびナトリウム塩、M C P A - イソオクチル、M C P A - チオ
 エチル、M
 C P B およびそのナトリウム塩、M C P B - エチル、メコプロップ、メコプロ
 ップ - P、
 メフェナセット、メフルイジド、メソスルフロ
 ン - メチル、メソトリオン、メ
 タム - ナ
 トリウム、メタミホブ、メタミトロン、メタザクロール、メタベンズチアズロ
 ン、メチル
 アルソン酸およびそのカルシウム、モノアンモニウム、モノソディウムおよびジ
 ナトリウ
 ム塩、メチル
 ダイムロ
 ン、メトベンズロ
 ン、メトプロムロ
 ン、メトラクロール、
 S - メトラ
 クロール、メトスラム、メトキシウロ
 ン、メトリブジン、メトスルフロ
 ン - メ
 チル、モリ
 ネット、モノリニュロン、ナプロアニリド、ナプロパミド、ナブタラム、ネブ
 ロ
 ン、ニコスル
 フロ
 ン、ノルフラゾン、オルベンカルブ、オルソスルファミロ
 ン、オリザ
 リン、オキサ
 ジアルギル、オキサジアゾン、オキサスルフロ
 ン、オキサジクロメフォン、
 オキシフル
 オルフェン、パラコートジクロリド、ペブレート、ペラルゴン酸、ペンディメ
 タリン、
 ペノキススラム、ペンタノクロル、ペントキサゾン、ペルフルイドン、ペトキサ
 ミド、ペソ
 キシアミド、フェンメディファム、ピクロラム、ピクロラム - カリウム、ピコ
 リナフェ
 ン、ピノキサ
 デン、ピペロホス、プレチラクロール、プリミスルフロ
 ン - メチル
 、プロジア
 ミン、プロホキシ
 ジム、プロメトン、プロメトリン、プロバクロル、プロパニ
 ル、プロパ
 キザホップ、プロバジン、プロファム、プロビスクロール、プロボキシカルバ
 ゾン、プロ
 ピザミド、プロスルホカルブ、プロスルフロ
 ン、ピラクロニル、ピラフルフェ
 ン - エチル、
 ピラスルホ
 トール、ピラゾギル、ピラゾリネート、ピラゾキシフェン、ピラ
 ゾスルフロ
 ン - エチル、
 ピリベンゾ
 キシム、ピリブチカルブ、ピリデート、ピリフタリド
 、ピリミノ
 バック - メチル、
 ピリミスル
 ファン、ピリチオバック、ピリチオバック - ナト
 リウム、
 ピロキサ
 スルホン、ピロキシスラム、キンクロラック、キンメラック、キノクラ
 ミン、キザ
 ロホップ - エチル、
 キザロホッ
 プ - P - エチル、
 キザロホッ
 プ - P - テフリル
 、リムスル
 フロ
 ン、セトキシ
 ジム、シデュロン、シマジン、シメトリン、スルコトリオン
 、スルフェ
 ントラゾ
 ン、スルホメツロ
 ン - メチル、スルホスルフロ
 ン、2 , 3 , 6 - T B
 A、T C A、
 T C A - ナトリ
 ウム、テブタム、テブチウロ
 ン、テフリルトリオン、テンボ
 トリオン、
 テブラロ
 キシジム、ターバシル、テルブメトン、テルブチラジン、テルブトリ
 ン、テニ
 ルクロール、チアゾビル、チエンカルバゾン、チフェンスルフロ
 ン - メチル、
 チオベン
 カルブ、チオカルバ
 ジル、トブラメゾン、トラルコキシジム、トリ - アレート、ト

リアスルフロン、トリアジフラム、トリベヌロン - メチル、トリクロピル、トリクロピル - ブトチル、トリクロピル - トリエチルアンモニウム、トリジファン、トリエタジン、トリフロキシスルフロン、トリフルラリン、トリフルスルフロン - メチル、トリトスルフロンおよびベルノレート。他の除草剤としてはまた、アルテルナリアデストルーエンス (*Alternaria destruens* Simmons)、コレトトリカムフロエオスポリオイデス (*Colletotrichum gloeosporioides* (Penz.) Penz. & Sacc.)、ドレックスレモノセラ (*Drechslera monoceras* (MTB-951))、ミロセシウムベルカリア (*Myrothecium verrucaria* (Albertini & Schweinitz) Ditmar: Fries)、フィトフトラパルミボラ (*Phytophthora palmivora* (Butl.) Butl.)、および、ブッキニアトラスペオス (*Puccinia thlaspeos* Schub.) などの生物除草剤が挙げられる。一定の事例において、本発明の化合物と、他の生物学的に有効な (特に除草性) 化合物または薬剤 (すなわち有効成分) との組み合わせは、雑草に対する超相加的 (すなわち相乗的) 効果、および / または、作物または他の所望の植物に対する未相加的 (すなわち薬害軽減化) 効果をもたらすことが可能である。効果的な有害生物の防除を保証しながら環境中に放出される有効成分の量を低減させることが常に望ましい。過剰な作物被害を伴わずにより多くの量の有効成分を用いてより効果的な雑草防除を提供する能力もまた望ましい。農業経済学的に満足できるレベルの雑草防除をもたらす施用量で雑草に対して除草性有効成分の相乗作用が生じる場合、このような組み合わせは、作物の生産コストを低下させるため、および、環境的負荷を低減させるために有利である可能性がある。除草性有効成分の薬害軽減が作物に対して生じる場合、このような組み合わせは、雑草との競合の軽減による作物の保護の増大に有利である可能性がある。

【0299】

注目すべきは、式1の化合物と、少なくとも1種の他の除草性有効成分との組み合わせである。特に注目すべきは、他の除草性有効成分が式1の化合物とは異なる作用部位を有するような組み合わせである。一定の事例においては、同様の防除範囲を有するが異なる作用部位を有する少なくとも1種の他の除草性有効成分との組み合わせが、耐性管理に関して特に有利であろう。それ故、本発明の組成物は、同様の防除範囲を有するが異なる作用部位を有する生物学的に有効な量の少なくとも1種の追加の除草性有効成分をさらに含むことが可能である。本発明の化合物の除草的に有効な量、ならびに、他の除草剤の除草的に有効な量は、単純な実験を通して当業者によって容易に判定されることが可能である。

【0300】

望ましくない植生のより良好な防除 (例えば、より低い使用量、より広い範囲の雑草の防除あるいは高い作物安全性) のため、または、耐性雑草の発生を防止するために、本発明の化合物と、2, 4-D、アミノシクロピラクロル、アトラジン、クロリムロン - エチル、クロルスルフロン、クロマゾン、ジフルヘニカン、ジメテナミド、フルフェナセット、フルメツラム、フルミオキサジン、フルピルスルフロン - メチル、フルピルスルフロン - メチル - ナトリウム、グリホサート (特にグリホサート - イソプロピルアンモニウム、グリホサート - ナトリウム、グリホサート - カリウム、グリホサート - トリメシウム塩)、イマザメタベンズ - メチル、イマザキン、イマゼタピル、イオドスルフロン - メチル、イソプロツロン、ラクトフェン、メソスルフロン - メチル、メソトリオン、メトリブジン、メトスルフロン - メチル、ニコスルフロン、リムスルフロン、S - メトラクロール、スルフェントラゾン、チフェンスルフロン - メチル、およびトリベヌロン - メチルからなる群から選択される除草剤との混合物が好ましい。特に好ましい混合物 (化合物番号は索引表A中の化合物を指す) は: 化合物1および2, 4-D; 化合物2および2, 4-D; 化合物3および2, 4-D; 化合物4および2, 4-D; 化合物5および2, 4-D; 化合物6および2, 4-D; 化合物7および2, 4-D; 化合物1およびアミノシクロピラクロル; 化合物2およびアミノシクロピラクロル; 化合物3およびアミノシクロピラクロル

50

化合物 6 およびイソプロツロン；化合物 7 およびイソプロツロン；化合物 1 およびラクトフェン；化合物 2 およびラクトフェン；化合物 3 およびラクトフェン；化合物 4 およびラクトフェン；化合物 5 およびラクトフェン；化合物 6 およびラクトフェン；化合物 7 およびラクトフェン；化合物 1 およびメソスルフロ - メチル；化合物 2 およびメソスルフロ - メチル；化合物 3 およびメソスルフロ - メチル；化合物 4 およびメソスルフロ - メチル；化合物 5 およびメソスルフロ - メチル；化合物 6 およびメソスルフロ - メチル；化合物 7 およびメソスルフロ - メチル；化合物 1 およびメソトリオン；化合物 2 およびメソトリオン；化合物 3 およびメソトリオン；化合物 4 およびメソトリオン；化合物 5 およびメソトリオン；化合物 6 およびメソトリオン；化合物 7 およびメソトリオン；化合物 1 およびメトリブジン；化合物 2 およびメトリブジン；化合物 3 およびメトリブジン；化合物 4 およびメトリブジン；化合物 5 およびメトリブジン；化合物 6 およびメトリブジン；化合物 7 およびメトリブジン；化合物 1 およびメトスルフロ - メチル；化合物 2 およびメトスルフロ - メチル；化合物 3 およびメトスルフロ - メチル；化合物 4 およびメトスルフロ - メチル；化合物 5 およびメトスルフロ - メチル；化合物 6 およびメトスルフロ - メチル；化合物 7 およびメトスルフロ - メチル；化合物 1 およびニコスルフロ - メチル；化合物 2 およびニコスルフロ - メチル；化合物 3 およびニコスルフロ - メチル；化合物 4 およびニコスルフロ - メチル；化合物 5 およびニコスルフロ - メチル；化合物 6 およびニコスルフロ - メチル；化合物 7 およびニコスルフロ - メチル；化合物 1 およびリムスルフロ - メチル；化合物 2 およびリムスルフロ - メチル；化合物 3 およびリムスルフロ - メチル；化合物 4 およびリムスルフロ - メチル；化合物 5 およびリムスルフロ - メチル；化合物 6 およびリムスルフロ - メチル；化合物 7 およびリムスルフロ - メチル；化合物 1 および S - メトラクロール；化合物 2 および S - メトラクロール；化合物 3 および S - メトラクロール；化合物 4 および S - メトラクロール；化合物 5 および S - メトラクロール；化合物 6 および S - メトラクロール；化合物 7 および S - メトラクロール；化合物 1 およびスルフェントラゾン；化合物 2 およびスルフェントラゾン；化合物 3 およびスルフェントラゾン；化合物 4 およびスルフェントラゾン；化合物 5 およびスルフェントラゾン；化合物 6 およびスルフェントラゾン；化合物 7 およびスルフェントラゾン；化合物 1 およびチフェンスルフロ - メチル；化合物 2 およびチフェンスルフロ - メチル；化合物 3 およびチフェンスルフロ - メチル；化合物 4 およびチフェンスルフロ - メチル；化合物 5 およびチフェンスルフロ - メチル；化合物 6 およびチフェンスルフロ - メチル；化合物 7 およびチフェンスルフロ - メチル；化合物 1 およびトリベヌロン - メチル；化合物 2 およびトリベヌロン - メチル；化合物 3 およびトリベヌロン - メチル；化合物 4 およびトリベヌロン - メチル；化合物 5 およびトリベヌロン - メチル；化合物 6 およびトリベヌロン - メチル；化合物 7 およびトリベヌロン - メチルの群から選択される。

【 0 3 0 1 】

また、特に好ましい混合物（化合物番号は索引表 A 中の化合物を指す）は：化合物 1 1 および 2 , 4 - D ; 化合物 1 2 および 2 , 4 - D ; 化合物 2 1 および 2 , 4 - D ; 化合物 2 6 および 2 , 4 - D ; 化合物 3 1 および 2 , 4 - D ; 化合物 3 5 および 2 , 4 - D ; 化合物 3 7 および 2 , 4 - D ; 化合物 3 8 および 2 , 4 - D ; 化合物 5 7 および 2 , 4 - D ; 化合物 6 1 および 2 , 4 - D ; 化合物 6 6 および 2 , 4 - D ; 化合物 7 2 および 2 , 4 - D ; 化合物 7 4 および 2 , 4 - D ; 化合物 7 8 および 2 , 4 - D ; 化合物 8 2 および 2 , 4 - D ; 化合物 1 1 およびアミノシクロピラクロル；化合物 1 2 およびアミノシクロピラクロル、化合物 2 1 およびアミノシクロピラクロル、化合物 2 6 およびアミノシクロピラクロル、化合物 3 1 およびアミノシクロピラクロル、化合物 3 5 およびアミノシクロピラクロル、化合物 3 7 およびアミノシクロピラクロル、化合物 3 8 およびアミノシクロピラクロル、化合物 5 7 およびアミノシクロピラクロル、化合物 6 1 およびアミノシクロピラクロル、化合物 6 6 およびアミノシクロピラクロル、化合物 7 2 およびアミノシクロピラクロル、化合物 7 4 およびアミノシクロピラクロル、化合物 7 8 およびアミノシクロピラクロル、化合物 8 2 およびアミノシクロピラクロル、化合物 1 2 およびアトラジン；化合物 2 1 およびアトラジン；化合物 2 6 およびアトラジン；化合物 3 1 およびアトラジン；化合物 3 5 およびアトラジン；化合物 3 7 およびアトラジン；化合物 3 8 およびアトラ

ジン；化合物 5 7 およびアトラジン；化合物 6 1 およびアトラジン；化合物 6 6 およびア
トラジン；化合物 7 2 およびアトラジン；化合物 7 4 およびアトラジン；化合物 7 8 およ
びアトラジン；化合物 8 2 およびアトラジン；化合物 1 1 およびプロモキシニル；化合物
1 2 およびプロモキシニル；化合物 2 1 およびプロモキシニル；化合物 2 6 およびプロモ
キシニル；化合物 3 1 およびプロモキシニル；化合物 3 5 およびプロモキシニル；化合物
3 7 およびプロモキシニル；化合物 3 8 およびプロモキシニル；化合物 5 7 およびプロモ
キシニル；化合物 6 1 およびプロモキシニル；化合物 6 6 およびプロモキシニル；化合物
7 2 およびプロモキシニル；化合物 7 4 およびプロモキシニル；化合物 7 8 およびプロモ
キシニル；化合物 8 2 およびプロモキシニル；化合物 1 1 およびオクタン酸プロモキシニ
ル；化合物 1 2 およびオクタン酸プロモキシニル；化合物 2 1 およびオクタン酸プロモキ
シニル；化合物 2 6 およびオクタン酸プロモキシニル；化合物 3 1 およびオクタン酸プロ
モキシニル；化合物 3 5 およびオクタン酸プロモキシニル；化合物 3 7 およびオクタン酸
プロモキシニル；化合物 3 8 およびオクタン酸プロモキシニル；化合物 5 7 およびオクタ
ン酸プロモキシニル；化合物 6 1 およびオクタン酸プロモキシニル；化合物 6 6 およびオ
クタン酸プロモキシニル；化合物 7 2 およびオクタン酸プロモキシニル；化合物 7 4 およ
びオクタン酸プロモキシニル；化合物 7 8 およびオクタン酸プロモキシニル；化合物 8 2
およびオクタン酸プロモキシニル；化合物 1 1 およびカルフェントラゾン - エチル；化合
物 1 2 およびカルフェントラゾン - エチル；化合物 2 1 およびカルフェントラゾン - エチ
ル；化合物 2 6 およびカルフェントラゾン - エチル；化合物 3 1 およびカルフェントラゾ
ン - エチル；化合物 3 5 およびカルフェントラゾン - エチル；化合物 3 7 およびカルフェ
ントラゾン - エチル；化合物 3 8 およびカルフェントラゾン - エチル；化合物 5 7 および
カルフェントラゾン - エチル；化合物 6 1 およびカルフェントラゾン - エチル；化合物 6
6 およびカルフェントラゾン - エチル；化合物 7 2 およびカルフェントラゾン - エチル；
化合物 7 4 およびカルフェントラゾン - エチル；化合物 7 8 およびカルフェントラゾン -
エチル；化合物 8 2 およびカルフェントラゾン - エチル；化合物 1 1 およびクロリムロン
- エチル；化合物 1 2 およびクロリムロン - エチル；化合物 2 1 およびクロリムロン - エ
チル；化合物 2 6 およびクロリムロン - エチル；化合物 3 1 およびクロリムロン - エチル
；化合物 3 5 およびクロリムロン - エチル；化合物 3 7 およびクロリムロン - エチル；化
合物 3 8 およびクロリムロン - エチル；化合物 5 7 およびクロリムロン - エチル；化合物
6 1 およびクロリムロン - エチル；化合物 6 6 およびクロリムロン - エチル；化合物 7 2
およびクロリムロン - エチル；化合物 7 4 およびクロリムロン - エチル；化合物 7 8 およ
びクロリムロン - エチル；化合物 8 2 およびクロリムロン - エチル；化合物 1 1 およびク
ロルスルフロン；化合物 1 2 およびクロルスルフロン；化合物 2 1 およびクロルスルフロ
ン；化合物 2 6 およびクロルスルフロン；化合物 3 1 およびクロルスルフロン；化合物 3
5 およびクロルスルフロン；化合物 3 7 およびクロルスルフロン；化合物 3 8 およびクロ
ルスルフロン；化合物 5 7 およびクロルスルフロン；化合物 6 1 およびクロルスルフロン
；化合物 6 6 およびクロルスルフロン；化合物 7 2 およびクロルスルフロン；
化合物 7 4 およびクロルスルフロン；化合物 7 8 およびクロルスルフロン；化合物 8 2 お
よびクロルスルフロン；化合物 1 1 およびクロマゾン；化合物 1 2 およびクロマゾン；化
合物 2 1 およびクロマゾン；化合物 2 6 およびクロマゾン；化合物 3 1 およびクロマゾン
；化合物 3 5 およびクロマゾン；化合物 3 7 およびクロマゾン；化合物 3 8 およびクロマ
ゾン；化合物 5 7 およびクロマゾン；化合物 6 1 およびクロマゾン；化合物 6 6 およびク
ロマゾン；化合物 7 2 およびクロマゾン；化合物 7 4 およびクロマゾン；化合物 7 8 およ
びクロマゾン；化合物 8 2 およびクロマゾン；化合物 1 1 およびクロピラリド；化合物 1
2 およびクロピラリド；化合物 2 1 およびクロピラリド；化合物 2 6 およびクロピラリド
；化合物 3 1 およびクロピラリド；化合物 3 5 およびクロピラリド；化合物 3 7 およびク
ロピラリド；化合物 3 8 およびクロピラリド；化合物 5 7 およびクロピラリド；化合物 6
1 およびクロピラリド；化合物 6 6 およびクロピラリド；化合物 7 2 およびクロピラリド
；化合物 7 4 およびクロピラリド；化合物 7 8 およびクロピラリド；化合物 8 2 およびク
ロピラリド；化合物 1 1 およびジカンバ；化合物 1 2 およびジカンバ；化合物 2 1 および

[illegible]

10

20

30

40

50

[illegible]

10

20

30

40

50

10

20

30

40

50

スルフロ - メチル ; 化合物 3 7 およびメトスルフロ - メチル ; 化合物 3 8 およびメト
スルフロ - メチル ; 化合物 5 7 およびメトスルフロ - メチル ; 化合物 6 1 およびメト
スルフロ - メチル ; 化合物 6 6 およびメトスルフロ - メチル ; 化合物 7 2 およびメト
スルフロ - メチル ; 化合物 7 4 およびメトスルフロ - メチル ; 化合物 7 8 およびメト
スルフロ - メチル ; 化合物 8 2 およびメトスルフロ - メチル ; 化合物 1 1 およびニコ
スルフロ ; 化合物 1 2 およびニコスルフロ ; 化合物 2 1 およびニコスルフロ ; 化合
物 2 6 およびニコスルフロ ; 化合物 3 1 およびニコスルフロ ; 化合物 3 5 およびニコ
スルフロ ; 化合物 3 7 およびニコスルフロ ; 化合物 3 8 およびニコスルフロ ; 化合
物 5 7 およびニコスルフロ ; 化合物 6 1 およびニコスルフロ ; 化合物 6 6 およびニコ
スルフロ ; 化合物 7 2 およびニコスルフロ ; 化合物 7 4 およびニコスルフロ ; 化合
物 7 8 およびニコスルフロ ; 化合物 8 2 およびニコスルフロ ; 化合物 1 1 およびオキ
シフルオルフェン ; 化合物 1 2 およびオキシフルオルフェン ; 化合物 2 1 およびオキシフ
ルオルフェン ; 化合物 2 6 およびオキシフルオルフェン ; 化合物 3 1 およびオキシフルオ
ルフェン ; 化合物 3 5 およびオキシフルオルフェン ; 化合物 3 7 およびオキシフルオルフ
ェン ; 化合物 3 8 およびオキシフルオルフェン ; 化合物 5 7 およびオキシフルオルフェン
 ; 化合物 6 1 およびオキシフルオルフェン ; 化合物 6 6 およびオキシフルオルフェン ; 化
合物 7 2 およびオキシフルオルフェン ; 化合物 7 4 およびオキシフルオルフェン ; 化合物
7 8 およびオキシフルオルフェン ; 化合物 8 2 およびオキシフルオルフェン ; 化合物 1 1
およびベンディメタリン ; 化合物 1 2 およびベンディメタリン ; 化合物 2 1 およびベン
ディメタリン ; 化合物 2 6 およびベンディメタリン ; 化合物 3 1 およびベンディメタリン ;
化合物 3 5 およびベンディメタリン ; 化合物 3 7 およびベンディメタリン ; 化合物 3 8 お
よびベンディメタリン ; 化合物 5 7 およびベンディメタリン ; 化合物 6 1 およびベン
ディメタリン ; 化合物 6 6 およびベンディメタリン ; 化合物 7 2 およびベンディメタリン ; 化
合物 7 4 およびベンディメタリン ; 化合物 7 8 およびベンディメタリン ; 化合物 8 2 およ
びベンディメタリン ; 化合物 1 1 およびプロナミド ; 化合物 1 2 およびプロナミド ; 化合
物 2 1 およびプロナミド ; 化合物 2 6 およびプロナミド ; 化合物 3 1 およびプロナミド ;
化合物 3 5 およびプロナミド ; 化合物 3 7 およびプロナミド ; 化合物 3 8 およびプロナミ
ド ; 化合物 5 7 およびプロナミド ; 化合物 6 1 およびプロナミド ; 化合物 6 6 およびプロ
ナミド ; 化合物 7 2 およびプロナミド ; 化合物 7 4 およびプロナミド ; 化合物 7 8 および
プロナミド ; 化合物 8 2 およびプロナミド ; 化合物 1 1 およびプロスルフロ ; 化合物 1
2 およびプロスルフロ ; 化合物 2 1 およびプロスルフロ ; 化合物 2 6 およびプロスル
フロ ; 化合物 3 1 およびプロスルフロ ; 化合物 3 5 およびプロスルフロ ; 化合物 3
7 およびプロスルフロ ; 化合物 3 8 およびプロスルフロ ; 化合物 5 7 およびプロスル
フロ ; 化合物 6 1 およびプロスルフロ ; 化合物 6 6 およびプロスルフロ ; 化合物 7
2 およびプロスルフロ ; 化合物 7 4 およびプロスルフロ ; 化合物 7 8 およびプロスル
フロ ; 化合物 8 2 およびプロスルフロ ; 化合物 1 1 およびピラスルホトール ; 化合物
1 2 およびピラスルホトール ; 化合物 2 1 およびピラスルホトール ; 化合物 2 6 および
ピラスルホトール ; 化合物 3 1 およびピラスルホトール ; 化合物 3 5 およびピラスルホト
ール ; 化合物 3 7 およびピラスルホトール ; 化合物 3 8 およびピラスルホトール ; 化合物 5
7 およびピラスルホトール ; 化合物 6 1 およびピラスルホトール ;
化合物 6 6 およびピラスルホトール ; 化合物 7 2 およびピラスルホトール ; 化合物 7 4 お
よびピラスルホトール ; 化合物 7 8 およびピラスルホトール ; 化合物 8 2 およびピラスル
ホトール ; 化合物 1 1 およびピロキシスラム ; 化合物 1 2 およびピロキシスラム ; 化合物
2 1 およびピロキシスラム ; 化合物 2 6 およびピロキシスラム ; 化合物 3 1 およびピロキ
シスラム ; 化合物 3 5 およびピロキシスラム ; 化合物 3 7 およびピロキシスラム ; 化合物
3 8 およびピロキシスラム ; 化合物 5 7 およびピロキシスラム ; 化合物 6 1 およびピロキ
シスラム ; 化合物 6 6 およびピロキシスラム ; 化合物 7 2 およびピロキシスラム ; 化合物
7 4 およびピロキシスラム ; 化合物 7 8 およびピロキシスラム ; 化合物 8 2 およびピロキ
シスラム ; 化合物 1 1 およびキンクロラック ; 化合物 1 2 およびキンクロラック ; 化合物
2 1 およびキンクロラック ; 化合物 2 6 およびキンクロラック ; 化合物 3 1 およびキンク

[illegible]

10

20

30

40

50

トリクロピル；化合物 7 4 およびトリクロピル；化合物 7 8 およびトリクロピル；化合物 8 2 およびトリクロピル；化合物 1 1 およびトリクロピル - ブトチル；化合物 1 2 およびトリクロピル - ブトチル；化合物 2 1 およびトリクロピル - ブトチル；化合物 2 6 およびトリクロピル - ブトチル；化合物 3 1 およびトリクロピル - ブトチル；化合物 3 5 およびトリクロピル - ブトチル；化合物 3 7 およびトリクロピル - ブトチル；化合物 3 8 およびトリクロピル - ブトチル；化合物 5 7 およびトリクロピル - ブトチル；化合物 6 1 およびトリクロピル - ブトチル；化合物 6 6 およびトリクロピル - ブトチル；化合物 7 2 およびトリクロピル - ブトチル；化合物 7 4 およびトリクロピル - ブトチル；化合物 7 8 およびトリクロピル - ブトチル；化合物 8 2 およびトリクロピル - ブトチル；化合物 1 1 およびトリクロピル - トリエチルアンモニウム；化合物 1 2 およびトリクロピル - トリエチルアンモニウム；化合物 2 1 およびトリクロピル - トリエチルアンモニウム；化合物 2 6 およびトリクロピル - トリエチルアンモニウム；化合物 3 1 およびトリクロピル - トリエチルアンモニウム；化合物 3 5 およびトリクロピル - トリエチルアンモニウム；化合物 3 7 およびトリクロピル - トリエチルアンモニウム；化合物 3 8 およびトリクロピル - トリエチルアンモニウム；化合物 5 7 およびトリクロピル - トリエチルアンモニウム；化合物 6 1 およびトリクロピル - トリエチルアンモニウム；化合物 6 6 およびトリクロピル - トリエチルアンモニウム；化合物 7 2 およびトリクロピル - トリエチルアンモニウム；化合物 7 4 およびトリクロピル - トリエチルアンモニウム；化合物 7 8 およびトリクロピル - トリエチルアンモニウム；化合物 8 2 およびトリクロピル - トリエチルアンモニウムの群から選択される。

【0302】

本発明の化合物はまた、ベノキサコール、BCS (1 - プロモ - 4 - [(クロロメチル)スルホニル]ベンゼン)、クロキントセットメキシル、シオメトリニル、シプロスルファミド、ジクロルミド、ジシクロノン、ジエトレート、2 - (ジクロロメチル) - 2 - メチル - 1, 3 - ジオキサラン (MG191)、フェンクロラゾール - エチル、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン - エチル、メフェンピル - ジエチル、メフェネート、メトキシフェノン (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) (3 - メチルフェニル) メタノン)、ナフタル酸無水物 (1, 8 - ナフタル酸無水物) およびオキサベトリニルなどの薬害軽減剤との組み合わせで用いられて、一定の作物に対する安全性を高めることが可能である。解毒的に有効な量の薬害軽減剤は、本発明の化合物と同時に適用されるか、または、種子処理として適用されることが可能である。従って、本発明の態様は、本発明の化合物および解毒的に有効な量の除草剤解毒剤を含む除草性混合物に関する。種子処理は、作物植物に対する解毒を物理的に制限するため、選択的な雑草防除のために特に有用である。従って、本発明の特に有用な実施形態は、作物の部位を除草的に有効な量の本発明の化合物と接触させる工程を含む作物における望ましくない植生の生長を選択的に防除する方法であって、ここで、作物が成長する種子が解毒的に有効な量の解毒剤で処理される。解毒剤の解毒的に有効量は、単純な実験を通して当業者によって容易に判定されることが可能である。

【0303】

本発明の化合物はまた、アビグリシン、N - (フェニルメチル) - 1H - プリン - 6 - アミン、エポコレオン、ジベレリン酸、ジベレリン A₄ および A₇、ハルピンタンパク質、メピコートクロリド、プロヘキサジオンカルシウム、プロヒドロジャスモン、ニトロフェノレートナトリウムならびにトリネキサバック - メチルなどの植物成長調整剤、ならびに、バチルスセレウス (*Bacillus cereus*) 菌株 BP01 などの植物の成長を改変させる生物との組み合わせで用いられることが可能である。

【0304】

農業保護剤 (すなわち除草剤、薬害軽減剤、殺虫剤、殺菌・殺力ピ剤、抗線虫薬、殺ダニ剤、および生物剤) についての一般的な文献としては、「The Pesticide Manual」、第13版、C. D. S. Tomlin 編、British Crop Protection Council、Farnham, Surrey, U.K.、

2003年および「BioPesticide Manual、第2版、L. G. Copping 編、British Crop Protection Council、Farnham, Surrey, U. K.、2001年」が挙げられる。

【0305】

これらの種々の混合相手の1つ以上が用いられる実施形態について、これらの種々の混合相手（合計で）対式1の化合物の重量比は、典型的には約1：3000～約3000：1である。約1：300～約300：1の重量比（例えば約1：30～約30：1の比）に注目すべきである。当業者は、単純な実験を通して、所望の範囲の生物活性のために必要な活性成分の生物学的有効量を容易に判定することが可能である。これらの追加の成分を含むことで、防除される雑草の範囲を、式1の化合物単独により防除される範囲を超えて拡大し得ることが明らかになるであろう。

10

【0306】

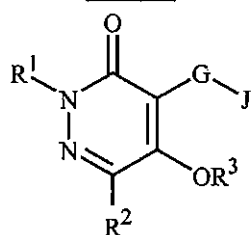
以下のテストは、本発明の化合物の特定の雑草に対する防除効力を実証する。しかしながら、化合物によってもたらされる雑草防除はこれらの種に限定されない。化合物の説明については索引表Aを参照のこと。以下の略語が以下の索引表において用いられている：tは第3級であり、iはイソであり、cはシクロであり、Meはメチルであり、CH₃OまたはOMeはメトキシであり、Prはプロピルであり、i-Prはイソプロピルであり、c-Prはシクロプロピルであり、t-Buはt-ブチルであり、SO₂はスルホニル（S(O)₂）を意味し、およびナフチルはナフタレニルを意味し、CF₃はトリフルオロメチルであり、CF₃Oはトリフルオロメトキシであり、THPはテトラヒドロピラニルを意味し、Phはフェニルを意味し、NO₂はニトロであり、Clはクロロであり、Fはフルオロであり、および、Brはブロモである。略記「Ex.」は「実施例」を表すと共に、化合物がどの実施例において調製されたかを示す数字が続く。

20

【0307】

【表 4 0】

索引表 A



化合物番号	R ¹	R ²	R ³	G	J	M.P. (°C)	
1(Ex 1)	Me	H	H	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	*	10
2	Me	H	CO-t-Bu	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	*	
3(Ex 2)	Me	H	H	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	*	
4	Me	H	H	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Br-Ph)	*	
5	Me	H	CO-c-Pr	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Br-Ph)	*	
6	Me	H	CO ₂ -i-Pr	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Br-Ph)	*	
7(Ex 3)	Me	H	CO ₂ -i-Pr	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	*	
8	Me	H	H	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-[3-(CF ₃)-Ph]	*	20
9	Me	H	CO ₂ -i-Pr	2-Me-1H-イミダゾール-1-イル	4-(4-Cl-Ph)	*	
10	Me	H	H	2-Me-1H-イミダゾール-1-イル	4-(4-Cl-Ph)	*	
11	Me	H	H	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	202~204	
12	Me	H	CO ₂ -i-Pr	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	179~182	
13	Me	H	CO ₂ -i-Pr	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃ O)-Ph]	*	
14	Me	H	H	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃ O)-Ph]	*	
15	Me	Me	H	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	*	
16	Me	Me	H	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	*	
17	Me	H	H	5-Me-1H-トリアゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	*	30
18	Me	H	CO-t-Bu	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	*	
19	Me	H	SO ₂ Me	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	*	
20	Me	H	H	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-(3,4-ジ-Cl-Ph)	*	
21	Me	H	H	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	*	
22	Me	H	CO ₂ -i-Pr	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-(3,4-ジ-Cl-Ph)	*	
23	Me	H	H	5-SMe-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-F-Ph)	*	
24	Me	H	H	4-Me-チアゾール-5-イル	2-[4-(CF ₃)-Ph]	209~213	
25	Me	H	H	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-F-Ph)	*	40

【 0 3 0 8 】

【表 4 1】

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	G	J	M.P.(°C)	
26	Me	H	H	4-Me-5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	227~229	
27	Me	i-Pr	H	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	*	
28	Me	H	H	4-Cl-1H-ピラゾール-3-イル	1-(4-Cl-Ph)	235~240	
29	Me	H	H	3-Me-1H-ピラゾール-4-イル	1-(4-Cl-Ph)	243~247	
30	Me	H	H	4-Me-1H-ピラゾール-3-イル	1-(4-Cl-Ph)	147~151	
31	Me	H	H	4-Br-1H-ピラゾール-3-イル	1-(4-Cl-Ph)	189~191	10
32	Me	H	CO-(3-Cl-Ph)	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	170~175	
33	Me	H	CO ₂ Me	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	149~151	
34	Me	H	CO-i-Pr	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	107~110	
35	Me	H	SO ₂ Ph	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	136~139	
36	Me	H	SO ₂ Me	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	122~125	
37	Me	H	CO-i-Bu	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	125~129	
38	Me	H	CO-(2-Cl-Ph)	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	103~106	
39	Me	H	SO ₂ Me	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	*	20
40	Me	H	CO-t-Bu	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	*	
41	Me	H	CO ₂ -i-Pr	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	*	
42	Me	CF ₃	H	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	*	
43	Me	H	H	5-n-Pr-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	*	
44	Me	CF ₃	H	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-[3-F-4-(CF ₃)-Ph]	*	
45	Me	H	H	5-c-Pr-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	*	
46	Me	H	H	2-Me-Ph	5-(4-Cl-Ph)	235~238	
47	Me	H	SO ₂ -1-ナフチル	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	156~160	
48	Me	H	CO-Ph	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	165~168	30
49	Me	H	SO ₂ -c-Pr	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	152~155	
50	Me	H	SO ₂ -i-Pr	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	130~134	
51	Me	H	SO ₂ -(2-NO ₂ -Ph)	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	186~189	
52	Me	H	CO-2-チエニル	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	150~153	
53	Me	H	CO ₂ Et	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	131~135	
54	Me	H	CO ₂ Ph	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	169~173	
55	Me	H	SO ₂ -(2-Cl-thien-5-イル)	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	128~131	
56	Me	H	CO-n-Pr	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	109~114	40
57	Me	H	CO ₂ -i-Bu	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	171~174	
58	Me	H	CO ₂ CH ₂ C≡CH	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	190~192	
59	Me	Me	H	5-Cl-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	*	

【 0 3 0 9 】

【表 4 2】

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	G	J	M.P. (°C)	
60	Me	H	H	2-Me-Ph	4-(4-Cl-1H-ピラゾール-1-イル)	*	
61	Me	H	H	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Br-Ph)	*	
62	Me	H	H	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CH ₃ O)-Ph]	*	
63	Me	H	H	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-(2-Cl-thien-5-イル)	*	
64	Me	H	CONMe ₂	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	191~194	
65	Et	H	H	3-Me-1H-ピラゾール-4-イル	1-(4-Cl-Ph)	160~165	10
66	Me	OMe	H	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	*	
67	Et	H	H	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	*	
68	Me	H	H	5-CH ₂ OMe-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Br-Ph)	117~120	
69	Me	H	CSNMe ₂	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	119~123	
70	Me	H	H	4-Br-5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Br-Ph)	*	
71	Me	H	H	4-Br-1H-ピラゾール-3-イル	1-[5-(CF ₃)-ピリジン-2-イル]	*	
72	Me	H	H	5-n-Pr-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	*	
73	CHCF ₃	H	H	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Br-Ph)	*	20
74	Me	Me	H	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Br-Ph)	203~205	
75	Me	Me	H	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	191~194	
76	Me	H	H	5-n-Pr-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	194~198	
77(Ex 9)	2-THP	H	H	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Br-Ph)	*	
78(Ex 10)	H	H	H	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Br-Ph)	325~335	
79(Ex 4)	Me	Me	H	5-Me-チアゾール-4-イル	2-(4-Cl-Ph)	*	
80(Ex 11)	CO-c-Pr	H	CO-c-Pr	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Br-Ph)	**	
81	Me	Me	H	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Br-Ph)	200~204	30
82	Me	OMe	H	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Br-Ph)	222~225	
83	Me	H	H	4-Me-5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Br-Ph)	*	
84	Me	H	H	4-Me-1H-ピラゾール-3-イル	1-(5-Cl-ピリジン-2-イル)	238~241	
85(Ex 7)	Me	H	H	4-Me-1H-ピラゾール-3-イル	1-[4-(CF ₃)-Ph]	150~154	

【 0 3 1 0 】

【表 4 3】

化合物番号	R ¹	R ²	R ³	G	J	M.P. (°C)
86	Me	Me	H	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	*
87(Ex 6)	Me	H	H	4-Br-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	237~241
88	Me	H	H	4-Cl-1H-ピラゾール-3-イル	1-[4-(CF ₃)-Ph]	176~179
89	Me	OMe	H	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Br-Ph)	214~216
90	Me	H	H	5-Me-ピリミジン-4-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	142~145
91	Me	H	H	5-n-Bu-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	*
92	Me	H	H	5-i-Bu-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Cl-Ph)	*
93	Me	OMe	H	5-Me-1H-ピラゾール-1-イル	3-(4-Br-Ph)	208~211
94	Me	H	CO-(6-Cl-ピリジン-3-イル)	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	*
95	Me	H	CO-c-ヘキシル	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	*
96	Me	H	SO ₂ N(Me) ₂	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	*
97	Me	H	CO-4-ホルホルニル	5-Et-1H-ピラゾール-1-イル	3-[4-(CF ₃)-Ph]	*

* ¹H NMR または質量スペクトルデータについては索引表 B を参照のこと

** ¹H NMR データについては合成実施例を参照のこと
化合物番号は、化合物番号を意味する

10

20

【 0 3 1 1 】

【表 4 4】

索引表 B

化合物番号	¹ H NMR データ(他に明記されていない限り CDCl ₃ 溶液) ^a または質量スペクトルデータ ^b
1	δ 7.89 (s, 3H), 7.86 (m, 2H), 7.68 (m, 2H), 6.60 (s, 1H), 3.81 (s, 3H), 2.35 (s, 3H)
2	δ 7.87 (s, 1H), 7.82 (m, 2H), 7.62 (m, 2H), 6.54 (s, 1H), 3.89 (s, 3H), 1.09 (s, 9H)
3	δ 7.77 (s, 1H), 7.66 (m, 2H), 7.40 (m, 2H), 6.46 (s, 1H), 3.80 (s, 3H), 2.27 (s, 3H)
4	δ 7.77 (s, 1H), 7.55 (m, 4H), 6.45 (s, 1H), 3.80 (s, 3H), 2.26 (s, 3H)
5	δ 7.84 (s, 1H), 7.67 (m, 2H), 7.52 (m, 2H), 6.46 (s, 1H), 3.87 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 1.65 (m, 1H), 0.92 (m, 2H), 0.86 (m, 2H)
6	δ 7.89 (s, 1H), 7.64 (m, 2H), 7.52 (m, 2H), 6.48 (s, 1H), 4.73 (m, 1H), 3.88 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 1.12 (m, 6H)
7	δ 7.89 (s, 1H), 7.69 (m, 2H), 7.35 (m, 2H), 6.45 (s, 1H), 4.75 (m, 1H), 3.88 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 1.12 (m, 6H)
8	δ 7.92 (s, 1H), 7.79 (s, 1H), 7.61 (m, 1H), 7.55 (m, 1H), 6.54 (s, 1H), 3.81 (s, 3H), 2.30 (s, 3H)
9	δ 7.93 (s, 1H), 7.68 (d, 2H), 7.32 (d, 2H), 7.26 (s, 1H), 4.64 - 4.94 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.08 - 1.34 (m, 6H)
10	DMSO-d ₆ δ 7.76 (d, 2H), 7.68 (s, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.46 (d, 2H), 3.58 (s, 3H), 2.23 (s, 3H)
13	δ 7.89 (s, 1H), 7.77 (m, 2H), 7.18 (m, 2H), 6.50 (s, 1H), 4.71 (m, 1H), 3.88 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 1.10 (m, 6H)
14	δ 7.77 (s, 1H), 7.73 (m, 2H), 7.26 (m, 2H), 6.42 (s, 1H), 3.79 (s, 3H), 2.18 (s, 3H)
15	δ 7.67 (d, 2H), 7.39 (d, 2H), 6.49 (s, 1H), 3.78 (s, 3H), 2.36 (s, 6H)
16	δ 7.89 (d, 2H), 7.67 (d, 2H), 6.62 (s, 1H), 3.78 (s, 3H), 2.80 (d, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.28 (t, 3H)
17	δ 7.89 (d, 2H), 7.81 (s, 1H), 7.37 (d, 2H), 3.80 (s, 3H), 2.52 (s, 3H)
18	δ 7.89 (s, 1H), 7.84 (m, 2H), 7.62 (m, 2H), 6.56 (s, 1H), 3.88 (s, 3H), 2.70 (m, 1H), 2.49 (m, 1H), 1.30 (m, 3H), 1.09 (s, 9H)
19	δ 8.09 (s, 1H), 7.90 (m, 2H), 7.65 (m, 2H), 6.62 (s, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.04 (s, 3H), 2.70 (br, 1H), 2.50 (br, 1H), 1.32 (m, 3H)
20	δ 7.85 (s, 1H), 7.79 (s, 1H), 7.59 (m, 1H), 7.50 (m, 1H), 6.52 (s, 1H), 3.82 (s, 3H), 2.73 (m, 2H), 1.25 (m, 3H)
21	δ 7.89 (s, 1H), 7.69 (m, 2H), 7.39 (m, 2H), 6.50 (s, 1H), 3.81 (s, 3H), 2.69 (m, 1H), 1.22 (m, 3H)
22	δ 7.91 (s, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.61 (m, 1H), 7.45 (m, 1H), 6.50 (s, 1H), 4.78 (m, 1H), 3.87 (s, 3H), 2.64 (br, 2H), 1.25 (m, 3H), 1.16 (br, 6H)
23	δ 7.79 (s, 1H), 7.73 (m, 2H), 7.13 (m, 2H), 6.57 (s, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.47 (s, 3H)
24	アセトン-d ₆ δ 8.19 (m, 2H), 7.84 (m, 2H), 7.81 (s, 1H), 3.69 (s, 3H), 2.35 (s, 3H)
25	δ 7.74 (s, 1H), 7.71 (m, 2H), 7.11 (m, 2H), 6.45 (s, 1H), 3.79 (s, 3H), 2.63 (m, 2H), 1.20 (m, 3H)
27	δ 7.78 (d, 2H), 7.66 (d, 2H), 6.36 (s, 1H), 3.75 (s, 3H), 3.23 (m, 1H), 2.07 (s, 3H), 1.24 (d, 6H)

10

20

30

40

【表 4 5】

化合物番号	¹ H NMR データ(他に明記されていない限り CDCl ₃ 溶液) ^a または質量スペクトルデータ ^b
32	δ 8.01 (s, 1H), 7.92 (m, 1H), 7.79 (m, 1H), 7.45 (m, 3H), 7.22 (m, 3H), 6.40 (s, 1H), 3.92 (s, 3H), 2.36 (m, 2H)
33	δ 7.91 (s, 1H), 7.73 (m, 2H), 7.34 (m, 2H), 6.46 (s, 1H), 3.88 (m, 3H), 3.71 (m, 3H), 2.33 (s, 3H)
39	δ 8.07 (s, 1H), 7.70 (m, 2H), 7.37 (m, 2H), 6.56 (s, 1H), 3.88 (s, 3H), 3.02 (s, 3H), 2.67 (br, 1H), 2.48 (br, 1H), 1.30 (m, 3H)
40	δ 7.82 (s, 1H), 7.71 (m, 2H), 7.34 (m, 2H), 6.48 (s, 1H), 3.87 (s, 3H), 2.73 (m, 1H), 2.46 (m, 1H), 1.29 (m, 3H), 1.09 (s, 9H)
41	δ 7.90 (s, 1H), 7.71 (m, 2H), 7.34 (m, 2H), 6.49 (s, 1H), 4.74 (m, 2H), 3.87 (s, 3H), 2.64 (br, 2H), 1.30 (m, 3H), 1.14 (m, 6H)
42	δ 7.84 (d, 2H) 7.69 (d, 2H) 6.60 (s, 1H) 3.86 (s, 3H) 2.38 (s, 3H)
43	δ 7.75 (s, 1H), 7.67 (m, 2H), 7.39 (m, 2H), 6.47 (s, 1H), 3.79 (s, 3H), 2.59 (m, 2H), 1.60 (m, 2H), 0.95 (m, 3H)
44	δ 7.79 (s, 1H), 7.62 (m, 3H), 6.56 (s, 1H), 3.82 (s, 3H), 2.70 (m, 2H), 1.24 (m, 3H)
45	δ 7.74 (s, 1H), 7.62 (m, 2H), 7.37 (m, 2H), 6.19 (s, 1H), 3.79 (s, 3H), 1.97 (m, 1H), 0.91 (m, 2H), 0.59 (m, 2H)
59	δ 7.60 (m, 2H), 7.39 (m, 2H), 6.56 (s, 1H), 3.75 (s, 3H), 2.32 (s, 3H)
60	δ 9.95 (br, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.26 (m, 1H), 7.04 (d, 1H), 3.65 (s, 3H), 2.04 (s, 3H)
61	δ 7.75 (s, 1H), 7.60 (m, 2H), 7.55 (m, 2H), 6.49 (s, 1H), 3.80 (s, 3H), 2.67 (m, 2H), 1.22 (m, 3H)
62	δ 7.71 (s, 1H), 7.63 (m, 2H), 6.95 (m, 2H), 6.39 (s, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 2.20 (s, 3H)
63	δ 7.75 (s, 1H), 7.11 (m, 2H), 6.88 (m, 2H), 6.36 (s, 1H), 3.79 (s, 3H), 2.66 (m, 2H), 1.22 (m, 3H)
66	DMSO-d ₆ δ 7.96 (m, 2H), 7.71 (m, 2H), 6.62 (s, 1H), 3.71 (s, 3H), 3.31 (s, 3H), 2.34 (m, 2H), 1.13 (m, 3H)
67	δ 7.87 (m, 2H), 7.82 (s, 1H), 7.66 (m, 2H), 6.61 (s, 1H), 4.24 (m, 2H), 2.76 (m, 2H), 1.39 (m, 3H), 1.27 (m, 3H)
70	δ 7.78 (m, 2H), 7.75 (s, 1H), 7.59 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 2.31 (s, 3H)
71	δ 8.82 (s, 1H), 8.74 (s, 1H), 8.11 (m, 1H), 7.97 (m, 1H), 7.77 (s, 1H), 3.83 (s, 3H)
72	アセトン-d ₆ δ 8.06 (m, 2H), 7.88 (s, 1H), 7.75 (m, 2H), 6.79 (s, 1H), 3.72 (s, 3H), 2.56 (m, 2H), 1.68 (m, 2H), 0.96 (m, 3H)
73	δ 7.82 (s, 1H), 7.60 (m, 2H), 7.57 (m, 2H), 6.51 (s, 1H), 4.79 (m, 2H), 2.64 (m, 2H), 1.22 (m, 3H)
77	質量スペクトル: AP + = 432
83	δ 7.70 (s, 1H), 7.57 (m, 2H), 7.48 (m, 2H), 3.78 (s, 3H), 2.69 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 1.05 (m, 3H)
86	δ 7.72 (m, 2H), 7.39 (m, 2H), 6.55 (s, 1H), 3.78 (s, 3H), 2.80 (m, 2H), 2.36 (s, 3H), 1.28 (m, 3H)
91	δ 7.74 - 7.80 (m, 1H), 7.68 (d, 2H), 7.39 (d, 2H), 6.51 (s, 1H), 3.80 (s, 3H), 2.66 (q, 2H), 1.52 - 1.63 (m, 2H), 1.30 - 1.43 (m, 2H), 0.92 (t, 3H)

10

20

30

40

【表 4 6】

化合物番号	¹ H NMR データ(他に明記されていない限り CDCl ₃ 溶液) ^a または質量スペクトルデータ ^b
92	DMSO-d ₆ δ 7.88 (s, 1H), 7.81 (d, 2H), 7.41 - 7.50 (m, 2H), 6.66 - 6.76 (m, 1H), 3.65 (s, 3H), 2.29 (dd, 2H), 1.76 - 1.93 (m, 1H), 0.87 (d, 6H)
94	8.84 (s, 1H), 8.03 (d, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.62 (d, 2H), 7.53 (d, 2H), 7.25 (dd, 1H), 6.51 (s, 1H), 3.93 (s, 3H), 2.70 (m, 2H), 1.33 (t, 3H)
95	7.90 (d, 2H) 7.83 (s, 1H), 7.62 (d, 2H), 6.55 (s, 1H), 3.87 (s, 3H), 2.80 - 2.50 (m, 2H), 2.35 (m, 1H), 1.68 (m, 2H), 1.55 (m, 4H), 1.35 (t, 3H), 1.33 (m, 2H), 1.1 (m, 2H)
96	8.18 (s, 1H), 7.90 (d, 2H), 7.59 (d, 2H), 6.60 (s, 1H), 3.89 (s, 3H), 2.72 (s, 6H), 2.71 - 2.50 (m, 2H), 1.30 (t, 3H)
97	8.02 (s, 1H), 7.9 (d, 2H), 7.76 (d, 2H), 6.58 (s, 1H), 3.88 (s, 3H), 3.33 (m, 8H), 2.80 - 2.50 (m, 2H), 1.33 (t, 3H)

化合物 No.は化合物を意味する。^a ¹H NMR データはテトラメチルシランより低磁場側に ppm。カップリングは、(s)-一重項、(m)-多重項、(d)-二重項、(q)-四重項、(dd)-二重項の二重項、(br)-幅広および(t)-三重項により示されている。^b 質量スペクトルは、大気圧化学イオン化(AP⁺)を用いて質量分光測定により観察された、H⁺(1 の分子量)の分子への付加により形成されるもっとも高い同位体存在度親イオン(M+1)の分子量として報告されている。

10

【 0 3 1 4 】

20

本発明の生物学的実施例

テスト A

イヌビエ (*Echinochloa crus-galli*)、オニメヒシバ (*Digitalis sanguinalis*)、アキノエノコログサ (*Setaria faberi*)、ノスズメノテッポウ (*Alopecurus myosuroides*)、ヒメカナリークサヨシ (*Phalaris minor*)、マルバルコウソウ (*Ipomoea coccinea*)、アオゲイトウ (*Amaranthus retroflexus*)、イチビ (*Abutilon theophrasti*)、コムギ (*Triticum aestivum*)、およびトウモロコシ (*Zea mays*) から選択した種の種子をローム土壌と砂とのブレンドに植えると共に、界面活性剤を含む非植物毒性溶媒混合物中で配合したテスト化学物質を用いる直接土壌噴霧で出芽前処理した。同時に、これらの種はまた、同一の様式で配合したテスト化学物質の出芽後適用でも処理した。

30

【 0 3 1 5 】

出芽後処理について、植物の高さは 2 ~ 10 cm の範囲であると共に、1 葉 ~ 2 葉ステージにあった。処理済みの植物および未処理の対照を温室中におよそ 10 日間維持し、その後、すべての処理済みの植物を未処理の対照と比較し、被害について視覚的に評価した。表 A 中にまとめられている植物応答評価は 0 ~ 100 のスケールに基づいており、ここで、0 は効果がなく、かつ、100 は完全な防除である。ダッシュ (-) 応答はテスト結果が存在しないことを意味する。

【 0 3 1 6 】

40

【表 4 7】

表 A	化合物		表 A	化合物		10										
1000 g ai/ha	1	2	1000 g ai/ha	1	2											
出芽後			出芽後													
イヌビエ	100	100	マルバールコウソウ	60	0											
トウモロコシ	100	90	アオゲイトウ	30	0											
オニメヒシバ	100	80	イチビ	60	40											
アキノエノコログサ	100	90	コムギ	100	90											
表 A	化合物															20
500 g ai/ha	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15	16		
出芽後																
イヌビエ	100	100	100	100	100	0	0	0	100	100	90	100	100	100		
トウモロコシ	100	100	100	100	100	0	0	0	90	90	60	80	90	100		
オニメヒシバ	100	100	100	90	90	0	0	0	100	100	80	90	100	100		
アキノエノコログサ	100	100	100	90	90	0	0	0	100	100	80	100	100	100		
マルバールコウソウ	60	20	0	50	20	50	0	0	0	0	0	0	0	0		
アオゲイトウ	10	20	0	30	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0		
イチビ	50	60	50	50	40	40	0	0	0	0	0	30	0	0		
コムギ	90	80	70	70	60	0	0	0	100	90	60	70	60	90		
表 A	化合物															
500 g ai/ha	17	19	20	21	22	23	24	26	27	28	29	30	31	42		

【 0 3 1 7 】

【表 4 8】

出芽後

イヌビエ	90	100	100	100	90	70	10	100	90	100	50	90	90	0
トウモロコシ	40	90	90	90	90	20	20	100	80	90	0	70	70	20
オニメヒシバ	80	100	100	100	80	20	10	100	80	90	50	90	90	0
アキノエノコログサ	90	100	100	100	80	80	40	100	90	90	80	90	90	10
マルバアルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	20	0	30	0	0	0	0
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	20	0	0	0	0	0	0
コムギ	50	90	70	80	60	0	20	60	90	70	20	50	60	10

10

表 A

化合物

500 g ai/ha

60 62 65 77

出芽後

イヌビエ	90	100	0	100
ノスズメノテッポウ	-	-	-	100
ヒメカナリークサヨシ	-	-	-	100
トウモロコシ	90	40	0	100
オニメヒシバ	60	90	20	100
アキノエノコログサ	80	60	20	100
マルバアルコウソウ	0	0	0	-
アオゲイトウ	0	0	0	0
イチビ	0	0	0	-
コムギ	50	20	0	90

表 A

化合物

250 g ai/ha

18

出芽後

Barnyardgrass	100
Corn	90
Crabgrass, Large	100
Foxtail, Giant	100
Morningglory	0
Pigweed	0
Velvetleaf	0
Wheat	80

20

表 A

化合物

125 g ai/ha

3 4 5 6 7 8 9 10 11 12 13 14 15 16

出芽後

イヌビエ	100	100	100	90	80	0	0	0	100	90	50	70	100	90
トウモロコシ	90	90	100	100	50	0	0	0	90	90	30	40	70	90
オニメヒシバ	100	100	100	90	80	0	0	0	90	90	20	60	90	90
アキノエノコログサ	100	100	100	90	90	0	0	0	90	80	70	80	90	100
マルバアルコウソウ	50	0	0	30	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
イチビ	0	20	20	40	20	20	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	70	60	60	50	40	0	0	0	80	70	50	40	50	70

30

40

表 A

化合物

125 g ai/ha

17 19 20 21 22 23 24 25 26 27 28 29 30 31

出芽後

イヌビエ	50	100	80	100	50	0	0	100	100	20	60	10	50	60
------	----	-----	----	-----	----	---	---	-----	-----	----	----	----	----	----

【表 4 9】

トウモロコシ	0	90	70	80	20	0	0	80	60	50	40	0	0	10	
オニメヒシバ	40	90	80	90	10	0	0	90	80	60	80	0	60	60	
アキノエノコログサ	80	100	90	100	60	20	0	100	90	50	90	0	80	90	
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
コムギ	0	60	50	60	20	0	0	20	0	50	50	0	40	40	10

表 A

化合物

125 g ai/ha	32	33	34	35	36	37	38	39	40	41	42	43	44	45	
出芽後															
イヌビエ	70	100	100	90	100	100	100	100	100	100	0	100	100	100	
トウモロコシ	50	90	90	60	80	100	90	100	100	90	20	80	90	80	
オニメヒシバ	70	100	100	90	90	90	100	100	100	90	0	90	100	100	
アキノエノコログサ	90	100	100	90	90	100	90	100	100	90	0	100	100	100	
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20
アオゲイトウ	10	0	10	0	10	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
コムギ	20	70	60	60	60	70	60	80	90	70	0	80	80	90	

表 A

化合物

125 g ai/ha	46	47	48	49	50	51	52	53	54	55	56	57	58	59	
出芽後															
イヌビエ	50	40	90	0	70	80	100	100	100	30	100	80	80	100	
トウモロコシ	50	10	60	0	30	60	100	90	90	40	100	60	60	70	30
オニメヒシバ	40	50	80	20	40	70	90	100	90	60	100	80	70	90	
アキノエノコログサ	60	60	80	20	60	70	90	100	100	70	100	90	90	90	
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	20	0	0	0	0	0	0	
アオゲイトウ	0	0	30	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
イチビ	0	0	70	0	0	0	20	0	0	0	0	0	0	0	
コムギ	30	10	60	0	20	40	60	70	60	30	80	50	60	60	

表 A

化合物

125 g ai/ha	60	61	62	63	64	65	66	67	68	69	70	71	72	73	40
出芽後															
イヌビエ	30	100	40	20	10	0	100	100	100	100	50	90	100	100	
ノスズメノテッポウ	-	-	-	-	-	-	-	-	80	60	10	-	100	90	
ヒメカナリークサヨシ	-	-	-	-	-	-	-	-	40	80	0	-	100	100	
トウモロコシ	40	100	0	30	60	0	100	100	50	90	20	40	100	100	
オニメヒシバ	20	100	50	10	40	0	100	100	10	80	0	80	90	100	

【表 5 0】

アキノエノコログサ	50	100	40	60	80	0	100	100	90	100	0	90	100	100
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	-	-	-	0	-	-
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	10
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	-	-	-	0	-	-
コムギ	0	90	0	20	0	0	100	100	0	30	0	80	90	70

表 A

化合物

125 g ai/ha	74	75	76	77	78	79	80	81	82	83	84	85	86	87
出芽後														
イヌビエ	100	90	100	50	100	50	100	100	100	100	0	30	100	90
ノスズメノテッポウ	100	90	100	100	100	100	100	100	100	100	0	40	100	80
ヒメカナリークサヨシ	100	80	100	60	70	90	100	100	100	100	0	20	100	70
トウモロコシ	100	90	100	80	100	30	100	100	100	100	0	0	90	40
オニメヒシバ	100	80	100	70	100	50	100	100	100	100	10	40	100	80
アキノエノコログサ	100	80	90	80	100	70	100	100	100	100	10	60	90	80
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	80	70	50	70	90	50	70	70	100	60	0	20	50	50

10

20

表 A

化合物

表 A

化合物

125 g ai/ha	88	89	90	92	93	94	95	62 g ai/ha	18
出芽後								出芽後	
イヌビエ	90	100	0	80	100	100	100	イヌビエ	90
ノスズメノテッポウ	70	100	0	50	100	100	100	トウモロコシ	80
ヒメカナリークサヨシ	70	100	0	30	100	100	100	オニメヒシバ	80
トウモロコシ	50	100	0	20	100	100	100	アキノエノコログサ	90
オニメヒシバ	90	100	0	10	100	100	100	マルバルコウソウ	0
アキノエノコログサ	90	100	0	60	100	100	100	アオゲイトウ	0
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	イチビ	0
コムギ	60	90	0	30	80	80	80	コムギ	70

30

表 A

化合物

31 g ai/ha	25	32	33	34	35	36	37	38	39	40	41	43	44	45
出芽後														
イヌビエ	80	0	90	90	60	80	90	40	100	100	80	90	100	80
トウモロコシ	20	0	60	70	0	50	60	20	70	90	60	50	70	40
オニメヒシバ	60	10	90	70	40	80	50	40	60	70	20	40	50	40
アキノエノコログサ	90	10	90	90	60	90	80	80	90	100	70	80	90	90
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0

40

【表 5 1】

コムギ	0	0	20	40	0	0	20	0	40	70	60	40	70	70
-----	---	---	----	----	---	---	----	---	----	----	----	----	----	----

表 A

化合物

31 g ai/ha	46	47	48	49	50	51	52	53	54	55	56	57	58	59
------------	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----

出芽後

イヌビエ	0	0	20	0	0	20	80	90	80	0	100	0	0	90
------	---	---	----	---	---	----	----	----	----	---	-----	---	---	----

トウモロコシ	20	0	20	0	0	20	30	80	40	0	90	0	0	30
--------	----	---	----	---	---	----	----	----	----	---	----	---	---	----

オニメヒシバ	0	10	20	0	0	20	60	80	70	10	80	0	0	50
--------	---	----	----	---	---	----	----	----	----	----	----	---	---	----

アキノエノコログサ	20	10	30	0	0	20	80	90	90	20	100	0	20	90
-----------	----	----	----	---	---	----	----	----	----	----	-----	---	----	----

マルバルクウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
----------	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

アオゲイトウ	0	0	20	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
--------	---	---	----	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

イチビ	0	0	20	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
-----	---	---	----	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

コムギ	0	0	0	0	0	0	30	20	30	0	70	0	0	0
-----	---	---	---	---	---	---	----	----	----	---	----	---	---	---

表 A

化合物

31 g ai/ha	61	63	64	66	67	68	69	70	71	72	73	74	75	76
------------	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----

出芽後

イヌビエ	100	0	0	100	100	10	90	0	10	50	60	100	10	90
------	-----	---	---	-----	-----	----	----	---	----	----	----	-----	----	----

ノスズメノテツボウ	-	-	-	-	-	0	10	0	-	80	90	100	40	90
-----------	---	---	---	---	---	---	----	---	---	----	----	-----	----	----

ヒメカナリークサヨシ	-	-	-	-	-	0	0	0	-	40	20	100	10	40
------------	---	---	---	---	---	---	---	---	---	----	----	-----	----	----

トウモロコシ	100	0	0	100	90	0	60	0	0	80	90	60	0	20
--------	-----	---	---	-----	----	---	----	---	---	----	----	----	---	----

オニメヒシバ	100	10	0	100	80	10	40	0	20	20	40	60	20	20
--------	-----	----	---	-----	----	----	----	---	----	----	----	----	----	----

アキノエノコログサ	100	0	30	100	100	50	90	0	30	90	50	70	50	70
-----------	-----	---	----	-----	-----	----	----	---	----	----	----	----	----	----

マルバルクウソウ	0	0	0	0	0	-	-	-	0	-	-	-	-	-
----------	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	10	0	0	0
--------	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	----	---	---	---

イチビ	0	0	0	0	0	-	-	-	0	-	-	-	-	-
-----	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

コムギ	80	0	0	90	90	0	0	0	0	60	40	70	10	20
-----	----	---	---	----	----	---	---	---	---	----	----	----	----	----

表 A

化合物

31 g ai/ha	78	79	80	81	82	83	84	85	86	87	88	89	90	92
------------	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----

出芽後

イヌビエ	90	0	100	90	100	100	0	0	100	0	10	100	0	0
------	----	---	-----	----	-----	-----	---	---	-----	---	----	-----	---	---

ノスズメノテツボウ	90	60	30	100	100	90	0	0	80	30	10	100	0	0
-----------	----	----	----	-----	-----	----	---	---	----	----	----	-----	---	---

ヒメカナリークサヨシ	40	40	40	60	100	70	0	0	-	10	30	100	0	0
------------	----	----	----	----	-----	----	---	---	---	----	----	-----	---	---

トウモロコシ	60	0	60	30	80	0	0	0	30	0	0	100	0	0
--------	----	---	----	----	----	---	---	---	----	---	---	-----	---	---

オニメヒシバ	80	30	60	90	100	60	0	0	70	10	40	100	0	0
--------	----	----	----	----	-----	----	---	---	----	----	----	-----	---	---

アキノエノコログサ	80	10	90	80	100	90	0	0	70	20	40	100	0	10
-----------	----	----	----	----	-----	----	---	---	----	----	----	-----	---	----

アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0
--------	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

コムギ	70	0	30	0	90	0	0	0	20	20	20	80	0	0
-----	----	---	----	---	----	---	---	---	----	----	----	----	---	---

【 0 3 2 1 】

【表 5 2】

表 A	化合物			表 A	化合物	
31 g ai/ha	93	94	95	1000 g ai/ha	1	2
出芽後				出芽前		
イヌビエ	100	100	100	イヌビエ	100	100
ノスズメノテッポウ	90	80	70	トウモロコシ	100	80
ヒメカナリークサヨシ	80	70	90	オニメヒシバ	90	100
トウモロコシ	80	100	90	アキノエノコログサ	100	100
オニメヒシバ	100	90	90	マルババルコウソウ	0	0
アキノエノコログサ	100	100	100	アオゲイトウ	20	0
アオゲイトウ	0	0	0	イチビ	0	60
コムギ	70	50	70	コムギ	90	90

10

表 A	化合物															
500 g ai/ha	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15	16		
出芽前																
イヌビエ	100	100	100	100	100	0	0	0	100	100	100	100	100	100	100	
トウモロコシ	90	90	90	90	90	0	0	0	100	90	70	60	90	90		
オニメヒシバ	100	100	100	100	100	0	0	0	100	100	90	90	100	100		
アキノエノコログサ	100	100	100	100	100	0	0	0	100	100	100	100	100	100	100	
マルババルコウソウ	0	0	0	40	20	0	0	0	30	0	0	0	0	0	0	
アオゲイトウ	0	0	0	40	0	0	0	0	30	0	0	0	0	0	0	
イチビ	10	10	20	50	30	0	0	0	0	0	20	20	0	0		
コムギ	90	100	100	90	80	0	0	0	100	100	70	80	80	100		

20

表 A	化合物															
500 g ai/ha	17	19	20	21	22	23	24	26	27	28	29	30	31	42		
出芽前																
イヌビエ	100	100	100	100	100	10	30	100	100	100	70	100	100	0		
トウモロコシ	40	90	90	100	70	20	0	90	80	90	0	70	70	0		
オニメヒシバ	70	100	100	100	90	0	60	100	100	100	40	100	100	0		
アキノエノコログサ	90	100	100	100	100	70	80	100	90	100	100	100	100	0		
マルババルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0		
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20	0		
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20	0	0	0	0		
コムギ	50	100	80	100	70	0	0	70	100	100	0	90	90	0		

30

40

表 A	化合物				表 A	化合物	
500 g ai/ha	60	62	65	77	250 g ai/ha	18	
出芽前					出芽前		

【 0 3 2 2 】

【表 5 3】

イヌビエ	100	90	0	100
ノズメノテツボウ	-	-	-	100
ヒメカナリークサヨシ	-	-	-	90
トウモロコシ	90	20	0	80
オニメヒシバ	80	60	0	100
アキノエノコログサ	100	30	90	100
マルバルコウソウ	0	0	0	-
アオゲイトウ	0	0	0	0
イチビ	0	0	0	-
コムギ	50	0	0	80

イヌビエ	100
トウモロコシ	90
オニメヒシバ	100
アキノエノコログサ	100
マルバルコウソウ	0
アオゲイトウ	0
イチビ	0
コムギ	100

10

表 A

化合物

125 g ai/ha	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15	16
出芽前														
イヌビエ	90	100	90	90	100	0	0	0	100	100	60	70	100	100
トウモロコシ	80	70	80	80	60	0	0	0	90	80	20	0	50	70
オニメヒシバ	100	100	100	100	100	0	0	0	100	100	60	70	80	90
アキノエノコログサ	100	100	100	100	100	0	0	0	100	100	70	80	90	100
マルバルコウソウ	0	0	0	30	20	0	0	0	0	0	0	0	0	0
アオゲイトウ	0	0	0	20	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
イチビ	0	0	0	40	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	70	70	90	80	60	0	0	0	100	90	20	10	60	70

20

表 A

化合物

125 g ai/ha	17	19	20	21	22	23	24	25	26	27	28	29	30	31
出芽前														
イヌビエ	40	100	90	100	30	0	0	100	100	80	100	0	100	100
トウモロコシ	0	80	60	90	30	0	0	50	50	20	80	0	0	50
オニメヒシバ	0	100	90	100	50	0	0	90	90	80	90	0	100	100
アキノエノコログサ	40	100	90	100	90	20	0	100	100	80	100	60	100	100
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0	0
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	20	90	60	90	40	0	0	50	20	40	70	0	40	60

30

40

表 A

化合物

125 g ai/ha	32	33	34	35	36	37	38	39	40	41	42	43	44	45
出芽前														
イヌビエ	90	100	100	100	100	100	100	100	100	100	0	100	100	100
トウモロコシ	60	90	60	80	80	90	70	90	90	90	0	90	80	60

【表 5 4】

オニメヒシバ	90	100	90	100	100	100	100	100	100	100	0	90	100	90
アキノエノコログサ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	0	100	100	100
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
アオゲイトウ	0	0	0	30	30	0	0	0	-	0	0	0	0	0
イチビ	10	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	60	80	70	80	90	90	60	80	90	80	0	70	80	80

表 A

化合物

10

125 g ai/ha	46	47	48	49	50	51	52	53	54	55	56	57	58	59
出芽前														
イヌビエ	100	80	100	0	100	100	100	100	100	80	100	100	100	100
トウモロコシ	0	40	80	0	20	80	70	70	60	40	80	50	20	60
オニメヒシバ	90	90	100	40	90	100	100	100	100	80	100	100	90	50
アキノエノコログサ	100	90	100	80	90	100	100	100	100	90	100	100	100	90
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	20	0	20	0	0	0	0	0
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	50	40	80	0	50	80	80	90	60	50	80	70	70	50

20

表 A

化合物

125 g ai/ha	60	61	62	63	64	65	66	67	68	69	70	71	72	73
出芽前														
イヌビエ	70	100	10	10	0	0	100	100	90	70	0	40	90	10
ノスズメノテッポウ	-	-	-	-	-	-	-	-	50	40	0	-	100	90
ヒメカナリークサヨシ	-	-	-	-	-	-	-	-	20	80	0	-	80	-
トウモロコシ	50	90	0	0	30	0	80	80	0	30	0	20	50	20
オニメヒシバ	20	100	20	0	50	0	70	90	10	90	0	60	60	50
アキノエノコログサ	80	100	0	0	50	0	100	100	100	90	0	100	90	30
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	-	-	-	0	-	-
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	-	-	-	0	-	-
コムギ	0	90	0	0	0	0	90	90	-	0	0	50	80	70

30

表 A

化合物

40

125 g ai/ha	74	75	76	77	78	79	80	81	82	83	84	85	86	87
出芽前														
イヌビエ	100	80	100	0	100	100	100	100	100	100	0	40	100	50
ノスズメノテッポウ	100	80	90	80	100	100	100	100	100	100	0	40	90	90
ヒメカナリークサヨシ	100	80	70	-	100	100	100	90	100	90	0	70	100	90
トウモロコシ	60	0	50	30	90	20	60	50	50	40	0	0	40	20

【表 5 5】

オニメヒシバ	90	40	80	10	100	100	100	100	100	70	0	70	90	70
アキノエノコログサ	100	80	100	30	100	100	100	100	100	100	0	100	100	90
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	30	0	0	0	0
コムギ	60	20	0	0	90	60	80	50	90	30	0	20	40	20

表 A	化合物							表 A	化合物						
125 g ai/ha	88	89	90	92	93	94	95	62 g ai/ha	18						
出芽前								出芽前							
イヌビエ	90	100	0	20	100	100	100	イヌビエ	100						
ノスズメノテッポウ	80	100	0	0	100	100	100	トウモロコシ	90						
ヒメカナリークサヨシ	70	100	0	10	90	90	100	オニメヒシバ	100						
トウモロコシ	20	70	0	20	60	90	90	アキノエノコログサ	100						
オニメヒシバ	90	100	0	20	100	100	100	マルババルコウソウ	0						
アキノエノコログサ	90	100	0	50	100	100	100	アオゲイトウ	0						
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	イチビ	0						
コムギ	40	90	0	0	80	90	90	コムギ	90						

10

20

表 A	化合物														
31 g ai/ha	25	32	33	34	35	36	37	38	39	40	41	43	44	45	
出芽前															
イヌビエ	50	20	100	70	80	90	90	90	100	100	100	100	80	90	
トウモロコシ	0	0	30	20	0	50	30	0	30	30	30	0	30	0	
オニメヒシバ	20	90	90	80	90	70	80	90	60	70	80	10	20	30	
アキノエノコログサ	40	90	100	100	100	100	100	90	90	100	90	90	80	90	
マルババルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
アオゲイトウ	0	-	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
コムギ	0	0	50	30	20	50	30	20	40	50	50	20	40	50	

30

表 A	化合物														
31 g ai/ha	46	47	48	49	50	51	52	53	54	55	56	57	58	59	
出芽前															
イヌビエ	40	20	60	0	10	80	70	100	70	0	80	60	50	90	
トウモロコシ	0	0	-	0	0	20	0	0	0	0	40	0	0	0	
オニメヒシバ	10	10	60	0	50	90	30	90	60	20	70	50	60	20	
アキノエノコログサ	50	70	90	0	70	90	100	100	90	80	90	90	90	70	
マルババルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	
イチビ	0	0	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	
コムギ	0	0	30	0	0	40	10	50	0	0	20	0	20	0	

40

【表 5 6】

表 A	化合物														
31 g ai/ha	61	63	64	66	67	68	69	70	71	72	73	74	75	76	
出芽前															
イヌビエ	90	0	0	10	0	0	20	0	0	20	0	100	0	40	
ノスズメノテッポウ	-	-	-	-	-	0	20	0	-	70	60	100	40	-	
ヒメカナリークサヨシ	-	-	-	-	-	0	-	0	-	50	30	80	10	30	
トウモロコシ	70	0	0	40	20	0	20	0	0	20	0	-	0	0	
オニメヒシバ	80	0	0	0	20	0	0	0	10	0	0	50	0	20	
アキノエノコログサ	100	0	0	90	40	10	20	0	0	70	0	90	20	70	
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	-	-	-	0	-	-	-	-	-	
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
イチビ	0	0	0	0	0	-	-	-	0	-	-	-	-	-	
コムギ	70	0	0	60	20	0	0	0	0	50	20	20	0	0	

10

表 A	化合物														
31 g ai/ha	78	79	80	81	82	83	84	85	86	87	88	89	90	92	
出芽前															
イヌビエ	0	0	0	70	50	20	0	0	50	0	0	30	0	0	
ノスズメノテッポウ	0	80	70	70	70	20	0	0	50	30	40	90	0	0	
ヒメカナリークサヨシ	0	0	60	50	20	-	0	40	-	0	0	50	0	0	
トウモロコシ	0	0	40	30	40	0	0	0	0	0	0	50	0	0	
オニメヒシバ	10	10	10	70	50	0	0	10	10	20	0	70	0	0	
アキノエノコログサ	20	10	80	80	90	0	0	0	10	20	40	90	0	0	
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
コムギ	0	0	20	20	50	0	0	0	0	0	0	40	0	0	

20

30

表 A	化合物			表 A	化合物		
31 g ai/ha	93	94	95	31 g ai/ha	93	94	95
出芽前				出芽前			
イヌビエ	20	50	50	オニメヒシバ	20	70	90
ノスズメノテッポウ	30	60	90	アキノエノコログサ	90	90	100
ヒメカナリークサヨシ	10	70	70	アオゲイトウ	0	0	0
トウモロコシ	30	-	40	コムギ	50	50	80

【0326】

40

テスト B

ノスズメノテッポウ (*Alopecurus myosuroides*)、ウマノチャヒキ (*Bromus tectorum*)、エノコログサ (*Setaria viridis*)、ネズミムギ (*Lolium multiflorum*)、コムギ (*Triticum aestivum*)、野生種のカラスムギ (*Avena fatua*)、シラホシムグラ (*Galium aparine*)、ギョウギシバ (*Cynodon dactylon*)、シグナルグラス (*Brachiaria decumbens*)、オナモミ (*Xanthium strumarium*)、トウモロコシ (*Zea mays*)、オニメヒシバ (*Digitaria sanguinalis*)、ナルコビエ (*Eriochloa villosa*)、アキノエノコログサ (*Setaria faberii*)、

50

オヒシバ (*Eleusine indica*)、セイバンモロコシ (*Sorghum halepense*)、ホウキギ (*Kochia scoparia*)、シロザ (*Chenopodium album*)、マルバルコウソウ (*Ipomoea coccinea*)、アメリカイヌホウズキ (*Solanum ptycanthum*)、ショクヨウガヤツリ (*Cyperus esculentus*)、アオゲイトウ (*Amaranthus retroflexus*)、ブタクサ (*Ambrosia elatior*)、ロシアアザミ (*Salisolia iberica*)、ダイズ (*Glycine max*)、一般的な (脂肪種子) ヒマワリ (*Helianthus annuus*)、および、イチビ (*Abutilon theophrasti*) から選択した植物種の種子を植えると共に、界面活性剤を含む非植物毒性溶媒混合物中で配合したテスト化学物質で出芽前処理した。

10

【0327】

同時に、これらの作物および雑草種、ならびに、冬オオムギ (*Hordeum vulgare*)、ヒメカナリークサヨシ (*Phalaris minor*)、ハコベ (*Stellaria media*) およびセイヨウヌカボ (*Apera spica-venti*) から選択した植物を、同一の様式で配合したテスト化学物質のいくつかの出芽後適用で処理した。出芽後処理について、植物の高さは、2 ~ 18 cm (1 葉 ~ 4 葉ステージ) の範囲であった。

【0328】

イネ (*Oryza sativa*)、タマガヤツリ (*Cyperus difformis*)、アメリカコナギ (*Heteranthera limosa*) およびイヌビエ (*Echinochloa crus-galli*) からなる湛水水田テスト中の植物種を、テストのために 2 葉ステージに成長させた。処理時に、テストポットを土壌表面上 3 cm に湛水し、テスト化合物の田面水への直接的な適用により処理し、次いで、テストの間はこの水深を維持した。処理済みの植物および対照を、13 ~ 15 日間にわたって温室中に維持した、その後、すべての種を対照と比較すると共に、視覚的に評価した。表 B 中にまとめられている植物応答評価は 0 ~ 100 のスケールに基づいており、ここで、0 は効果がなく、かつ、100 は完全な防除である。ダッシュ (-) 応答はテスト結果が存在しないことを意味する。

20

【0329】

30

【表 57】

表 B	化合物														
250 g ai/ha	1	2	3	4	5	6	7	11	12	13	14	15	16	17	
湛水															
イヌビエ	60	45	80	75	90	90	85	75	80	0	20	60	60	0	
アメリカコナギ	30	40	40	85	65	70	40	40	50	0	40	100	0	95	
イネ	50	45	80	80	80	90	65	70	80	0	20	70	80	40	
タマガヤツリ	60	-	80	100	80	95	80	40	60	0	60	70	45	70	

40

表 B	化合物														
250 g ai/ha	19	20	21	22	25	26	27	28	29	30	31	32	33	34	
湛水															
イヌビエ	75	0	100	0	0	20	30	30	0	0	0	70	100	100	
アメリカコナギ	25	0	65	0	0	70	75	0	0	0	0	40	50	40	
イネ	70	0	70	0	0	0	0	60	0	0	0	65	80	80	

【0330】

50

【表 5 8】

タマガヤツリ	70	0	30	0	0	75	65	0	0	0	0	30	60	0
--------	----	---	----	---	---	----	----	---	---	---	---	----	----	---

表 B

化合物

250 g ai/ha

36	37	38	39	40	41	42	43	44	45	46	47	48	49
----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----

湛水

イヌビエ	0	100	95	85	100	95	0	-	50	65	40	0	30	0
------	---	-----	----	----	-----	----	---	---	----	----	----	---	----	---

アメリカコナギ	0	75	40	80	0	70	0	30	70	75	85	0	30	0
---------	---	----	----	----	---	----	---	----	----	----	----	---	----	---

イネ	0	90	85	80	80	80	0	20	40	45	35	0	0	0
----	---	----	----	----	----	----	---	----	----	----	----	---	---	---

タマガヤツリ	0	60	70	85	0	85	0	0	30	65	75	0	50	0
--------	---	----	----	----	---	----	---	---	----	----	----	---	----	---

10

表 B

化合物

250 g ai/ha

50	51	52	53	54	55	56	57	58	59	60	61	62	63
----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----

湛水

イヌビエ	0	30	75	40	80	65	60	0	70	50	30	100	0	0
------	---	----	----	----	----	----	----	---	----	----	----	-----	---	---

アメリカコナギ	0	0	0	50	0	75	75	70	45	20	0	70	0	0
---------	---	---	---	----	---	----	----	----	----	----	---	----	---	---

イネ	0	0	60	30	80	30	10	15	60	25	30	60	0	0
----	---	---	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	---	---

タマガヤツリ	0	70	0	70	0	80	85	80	0	30	0	30	0	0
--------	---	----	---	----	---	----	----	----	---	----	---	----	---	---

20

表 B

化合物

250 g ai/ha

64	65	66	67	68	69	72	73	75	76	77	80	81	83
----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----

湛水

イヌビエ	0	0	20	50	0	0	70	0	0	0	0	0	0
------	---	---	----	----	---	---	----	---	---	---	---	---	---

アメリカコナギ	0	40	0	75	0	0	40	0	0	0	0	0	-
---------	---	----	---	----	---	---	----	---	---	---	---	---	---

イネ	0	15	30	15	0	0	65	0	0	0	0	0	0
----	---	----	----	----	---	---	----	---	---	---	---	---	---

タマガヤツリ	0	80	0	0	0	0	65	0	0	0	0	0	0
--------	---	----	---	---	---	---	----	---	---	---	---	---	---

30

表 B

化合物

250 g ai/ha

84	85	86	87
----	----	----	----

湛水

イヌビエ	0	0	40	0
------	---	---	----	---

アメリカコナギ	0	0	65	0
---------	---	---	----	---

イネ	0	0	35	0
----	---	---	----	---

タマガヤツリ	0	0	55	0
--------	---	---	----	---

表 B

化合物

125 g ai/ha

1	2	3	4	5	6	7	11	12	13	14	15	16	17
---	---	---	---	---	---	---	----	----	----	----	----	----	----

湛水

イヌビエ	20	20	70	70	70	80	65	65	60	0	20	40	40	0
------	----	----	----	----	----	----	----	----	----	---	----	----	----	---

アメリカコナギ	0	0	0	85	50	60	20	0	40	0	40	80	0	40
---------	---	---	---	----	----	----	----	---	----	---	----	----	---	----

イネ	0	15	75	70	75	80	45	60	70	0	0	15	45	20
----	---	----	----	----	----	----	----	----	----	---	---	----	----	----

タマガヤツリ	40	60	80	90	80	85	80	40	60	0	-	60	30	40
--------	----	----	----	----	----	----	----	----	----	---	---	----	----	----

40

【 0 3 3 1 】

【表 5 9】

表 B	化合物														
125 g ai/ha	19	20	21	22	26	27	28	29	30	31	32	33	34	35	
湛水															
イヌビエ	60	0	80	0	0	0	0	0	0	0	65	85	100	0	
アメリカコナギ	0	0	0	0	-	60	0	0	0	0	40	40	30	0	
イネ	60	0	20	0	0	0	0	0	0	0	30	75	70	0	
タマガヤツリ	60	0	0	0	0	30	0	0	0	0	30	35	0	0	10
表 B	化合物														
125 g ai/ha	36	37	38	39	40	41	42	43	44	45	46	47	48	49	
湛水															
イヌビエ	0	100	95	65	100	80	0	75	30	60	30	0	0	0	
アメリカコナギ	0	70	30	0	0	40	0	0	70	0	45	0	0	-	
イネ	0	80	75	50	70	50	0	20	20	45	20	0	0	0	
タマガヤツリ	0	0	70	0	0	0	0	0	20	0	60	0	0	0	20
表 B	化合物														
125 g ai/ha	50	51	53	55	56	57	61	62	63	65	66	67	68	69	
湛水															
イヌビエ	0	10	0	0	20	0	50	0	0	0	20	35	0	0	
アメリカコナギ	0	0	50	0	40	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
イネ	0	0	0	0	0	10	15	0	0	0	0	0	0	0	
タマガヤツリ	0	60	40	75	85	75	0	0	0	0	0	0	0	0	
表 B	化合物														30
125 g ai/ha	72	73	77	80	81	83									
湛水															
イヌビエ	40	0	0	0	0	0									
アメリカコナギ	0	0	0	0	0	0									
イネ	45	0	0	0	0	0									
タマガヤツリ	60	0	0	0	0	0									
表 B	化合物														
62 g ai/ha	1	2	3	4	5	6	7	11	12	13	14	15	16	17	40
湛水															
イヌビエ	0	0	60	60	50	40	45	50	30	0	0	15	20	0	
アメリカコナギ	0	0	0	75	40	50	0	0	0	0	0	0	0	40	
イネ	0	15	60	40	60	30	30	30	20	0	0	0	20	15	
タマガヤツリ	40	50	60	60	70	70	80	30	40	0	60	50	30	40	

【表 6 0】

表 B

化合物

62 g ai/ha

19 20 21 22 25 26 27 28 29 30 31 32 33 34

湛水

イヌビエ

30 0 75 0 0 0 0 0 0 0 0 20 60 50

アメリカコナギ

0 0 0 0 0 50 40 0 0 0 0 30 0 0

イネ

20 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 65 40

タマガヤツリ

30 0 0 0 0 0 20 0 0 0 0 30 20 0

10

表 B

化合物

62 g ai/ha

35 36 37 38 39 40 41 42 43 44 45 46 47 48

湛水

イヌビエ

0 0 60 95 80 85 75 0 50 0 20 0 0 0

アメリカコナギ

0 0 70 - 0 0 0 0 0 0 0 30 0 0

イネ

0 0 70 75 0 40 20 0 15 15 0 0 0 0

タマガヤツリ

0 0 0 - 0 0 0 0 0 0 0 50 0 0

20

表 B

化合物

62 g ai/ha

49 50 51 52 53 54 55 56 57 58 59 60 61 62

湛水

イヌビエ

0 0 0 15 0 20 0 0 0 30 0 0 0 0

アメリカコナギ

0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

イネ

0 0 0 10 0 15 0 0 0 0 10 0 0 0

タマガヤツリ

0 0 40 0 0 0 70 75 65 0 0 0 0 0

表 B

化合物

62 g ai/ha

63 64 65 66 67 68 69 72 73 75 76 77 80 81

湛水

イヌビエ

0 0 0 0 25 0 0 20 0 0 0 0 0 0

アメリカコナギ

0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

イネ

0 0 0 0 0 0 0 15 0 0 0 0 0 0

タマガヤツリ

0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

30

表 B

化合物

62 g ai/ha

83 84 85 86 87

湛水

イヌビエ

0 0 0 0 0

アメリカコナギ

0 0 0 30 0

イネ

0 0 0 30 0

タマガヤツリ

0 0 0 0 0

40

【 0 3 3 3 】

【表 6 1】

表 B	化合物														
31 g ai/ha	1	2	3	4	5	6	7	11	12	13	14	15	16	17	
湛水															
イヌビエ	0	0	0	0	20	0	20	40	0	0	0	0	15	0	
アメリカコナギ	0	0	0	0	30	40	0	0	0	0	0	0	0	40	
イネ	0	0	20	15	15	20	20	0	0	0	0	0	0	0	
タマガヤツリ	0	0	60	40	70	30	70	30	0	0	0	0	0	30	10
表 B	化合物														
31 g ai/ha	19	20	21	22	26	27	28	29	30	31	32	33	34	35	
湛水															
イヌビエ	0	0	55	0	0	0	0	0	0	0	10	30	40	0	
アメリカコナギ	0	0	0	0	40	0	0	0	0	0	30	0	0	0	
イネ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	30	0	0	
タマガヤツリ	0	0	0	0	0	20	0	0	0	0	20	0	0	0	
表 B	化合物														
31 g ai/ha	36	37	38	39	40	41	42	43	44	45	46	47	48	49	20
湛水															
イヌビエ	0	30	20	0	60	60	0	40	0	20	0	0	0	0	
アメリカコナギ	0	-	40	0	0	0	0	0	-	0	-	0	0	0	
イネ	0	0	0	0	35	15	0	0	0	0	0	0	0	0	
タマガヤツリ	0	-	20	0	0	0	0	0	0	0	40	0	0	0	
表 B	化合物														
31 g ai/ha	50	51	53	55	56	57	61	62	63	65	66	67	68	69	30
湛水															
イヌビエ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
アメリカコナギ	0	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	
イネ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
タマガヤツリ	0	0	0	45	70	45	0	0	0	0	0	0	0	0	
表 B	化合物														
31 g ai/ha	72	73	77	80	81	83									40
湛水															
イヌビエ	0	0	0	0	0	0									
アメリカコナギ	0	0	0	0	0	0									
イネ	10	0	0	0	0	0									
タマガヤツリ	0	0	0	0	0	0									

【 0 3 3 4 】

【表 6 2】

表 B	化合物								
250 g ai/ha	1	3	4	5	6	7	15	16	
出芽後									
オオムギ	30	0	95	95	80	0	-	98	
ギョウギシバ	100	100	100	100	100	100	100	100	
ノスズメノテッポウ	100	100	100	100	100	100	98	100	
ウマノチャヒキ	100	5	40	-	10	0	60	100	10
ヒメカナリークサヨシ	40	90	100	100	100	90	-	-	
ハコベ	5	0	20	0	0	0	0	0	
オナモミ	0	0	0	20	40	0	0	0	
トウモロコシ	100	100	100	100	100	90	-	100	
オニメヒシバ	100	100	100	100	100	100	100	100	
ナルコビエ	100	100	100	100	100	100	100	100	
アキノエノコログサ	100	100	100	100	100	100	100	100	
エノコログサ	100	100	100	100	100	100	100	100	20
オヒシバ	85	100	100	100	100	100	100	80	
セイバンモロコシ	100	-	-	90	-	0	100	100	
ホウキギ	20	70	70	70	20	10	0	100	
シロザ	50	20	80	80	70	10	0	0	
マルバルコウソウ	0	0	0	0	50	0	0	0	
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	-	0	0	0	0	
野生種のカラスムギ	100	100	100	100	100	95	100	100	
アオゲイトウ	40	25	50	45	40	20	0	0	30
ブタクサ	55	50	80	65	50	0	40	0	
ネズミムギ	100	100	100	100	100	100	100	100	
ダイズ	60	60	90	70	90	-	0	0	
シグナルグラス	100	100	100	100	100	100	100	100	
イチビ	50	0	45	10	10	0	0	0	
コムギ	95	100	100	100	100	-	85	100	
セイヨウヌカボ	100	100	100	100	100	100	100	100	

表 B	化合物										
125 g ai/ha	1	3	4	5	6	7	11	12	15	16	
出芽後											
オオムギ	0	0	90	95	80	0	100	100	90	95	
ギョウギシバ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	
ノスズメノテッポウ	100	100	100	100	100	100	100	100	95	100	
ウマノチャヒキ	95	5	20	50	5	0	100	-	45	90	
ヒメカナリークサヨシ	0	85	100	100	100	90	100	100	85	-	

【表 6 3】

ハコベ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
トウモロコシ	100	100	100	100	100	90	100	100	95	100
オニメヒシバ	100	100	100	100	100	100	100	100	98	100
ナルコビエ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
アキノエノコログサ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
エノコログサ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
オヒシバ	50	100	100	100	100	100	100	100	90	75
セイバンモロコシ	100	-	100	85	-	0	100	100	100	100
ホウキギ	0	60	60	0	20	0	0	0	0	98
シロザ	40	15	60	80	20	0	0	40	0	0
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	40	0	0
シヨクヨウガヤツリ	0	0	0	60	0	0	0	0	0	0
野生種のカラスムギ	100	100	100	100	100	95	100	100	98	100
アオゲイトウ	0	10	35	45	0	0	5	50	0	0
ブタクサ	50	0	50	60	0	0	0	0	0	0
ネズミムギ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
ダイズ	50	40	90	65	75	-	0	0	0	0
シグナルグラス	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
イチビ	0	0	20	0	0	0	0	30	0	0
コムギ	90	100	100	100	100	95	100	100	70	100
セイヨウヌカボ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100

10

20

表 B

化合物

62 g ai/ha

出芽後

	1	3	4	5	6	7	11	12	15	16	19	20	21	25
オオムギ	0	0	10	90	30	0	100	100	10	90	90	0	100	0
ギョウギシバ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	0	100	60
ノスズメノテツボウ	90	100	100	100	100	90	100	100	95	100	95	60	100	95
ウマノチャヒキ	60	5	5	50	5	0	98	85	15	70	90	50	85	15
ヒメカナリークサヨシ	0	85	90	100	95	-	100	100	35	95	100	-	100	10
ハコベ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
トウモロコシ	100	100	95	100	95	90	100	100	95	98	95	-	100	-
オニメヒシバ	90	100	100	100	100	100	100	100	90	95	100	90	100	80
ナルコビエ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	95	100	100	100	100
アキノエノコログサ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	98	100	95	100	95
エノコログサ	100	100	100	100	100	100	100	100	95	98	100	95	100	98
オヒシバ	30	95	100	95	100	100	100	100	60	65	90	80	100	50

30

40

【表 6 4】

セイバンモロコシ	90	80	-	0	0	-	100	100	80	100	100	100	100	30
ホウキギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	65	0	0	0	0
シロザ	0	0	0	20	0	0	0	0	0	0	0	40	0	10
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	30	0	0	0
野生種のカラスムギ	100	95	100	100	100	95	100	100	98	100	100	90	100	95
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	5	0	0	0	0	0	10
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ネズミムギ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	90	100	95
ダイズ	25	40	30	50	60	0	0	0	0	0	0	0	10	0
シグナルグラス	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
イチビ	0	0	5	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	90	90	100	100	100	80	100	95	60	98	98	60	100	0
セイヨウヌカボ	100	100	100	100	95	85	100	100	90	100	100	90	100	98

10

表 B

化合物

20

62 g ai/ha	26	28	32	33	34	35	36	37	38	39	40	41	43	44
出芽後														
オオムギ	0	-	0	30	15	35	15	15	10	70	70	0	50	20
ギョウギシバ	0	100	100	100	100	100	100	100	100	95	98	95	-	100
ノスズメノテッポウ	80	100	70	95	90	90	80	90	98	100	90	95	100	98
ウマノチャヒキ	60	20	60	80	80	60	50	75	60	80	100	85	65	90
ヒメカナリークサヨシ	-	-	30	-	20	45	10	40	30	50	80	0	95	-
ハコベ	0	0	20	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
トウモロコシ	100	40	0	100	98	100	40	100	100	100	100	95	100	95
オニメヒシバ	80	98	98	100	100	100	100	100	100	100	100	100	85	98
ナルコビエ	98	95	100	100	100	100	95	100	100	100	100	100	95	100
アキノエノコログサ	100	100	100	100	100	100	60	100	100	100	100	100	100	100
エノコログサ	98	100	95	100	100	95	70	85	98	100	100	100	100	100
オヒシバ	20	90	70	100	80	75	100	100	100	100	100	98	85	90
セイバンモロコシ	20	98	98	90	100	95	100	100	100	95	100	75	100	100
ホウキギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シロザ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
野生種のカラスムギ	100	98	95	98	100	95	90	98	100	100	100	100	100	100
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0

30

40

【表 6 5】

ネズミムギ	100	98	95	100	100	98	95	100	98	100	100	100	100	100
ダイズ	0	20	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シグナルグラス	100	90	98	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
イチビ	0	0	0	5	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	5	90	-	98	90	85	85	95	95	98	100	85	100	95
セイヨウヌカボ	95	85	50	70	80	40	65	85	80	100	100	85	100	100

表 B

化合物

10

62 g ai/ha	45	48	52	53	54	56	57	59	61	66	67	68	69	72
------------	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----

出芽後

オオムギ	5	10	0	0	0	75	40	50	90	-	-	0	0	95
------	---	----	---	---	---	----	----	----	----	---	---	---	---	----

ギョウギシバ	98	100	100	100	100	100	100	20	100	100	75	0	98	80
--------	----	-----	-----	-----	-----	-----	-----	----	-----	-----	----	---	----	----

ノスズメノテツボウ	90	95	95	95	70	98	95	90	100	100	100	85	90	100
-----------	----	----	----	----	----	----	----	----	-----	-----	-----	----	----	-----

ウマノチャヒキ	90	90	70	90	70	0	60	10	98	98	100	0	45	30
---------	----	----	----	----	----	---	----	----	----	----	-----	---	----	----

ヒメカナリークサヨシ	0	-	5	0	0	95	60	70	85	-	-	10	0	95
------------	---	---	---	---	---	----	----	----	----	---	---	----	---	----

ハコベ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
-----	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

20

オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
------	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

トウモロコシ	95	100	98	100	100	95	100	90	100	100	100	95	20	100
--------	----	-----	----	-----	-----	----	-----	----	-----	-----	-----	----	----	-----

オニメヒシバ	100	100	100	100	98	100	100	60	100	100	100	85	100	100
--------	-----	-----	-----	-----	----	-----	-----	----	-----	-----	-----	----	-----	-----

ナルコビエ	100	100	100	100	100	100	100	85	100	100	100	60	100	90
-------	-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----	----	-----	-----	-----	----	-----	----

アキノエノコログサ	100	100	100	100	100	100	100	95	100	100	100	90	100	100
-----------	-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----	----	-----	-----	-----	----	-----	-----

エノコログサ	100	100	100	100	100	100	100	95	100	100	100	95	95	100
--------	-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----	----	-----	-----	-----	----	----	-----

オヒシバ	95	95	85	100	98	98	90	0	100	98	90	5	90	35
------	----	----	----	-----	----	----	----	---	-----	----	----	---	----	----

セイバンモロコシ	70	100	95	100	100	100	100	80	100	100	100	30	75	100
----------	----	-----	----	-----	-----	-----	-----	----	-----	-----	-----	----	----	-----

30

ホウキギ	0	0	0	0	0	0	0	0	45	0	0	0	98	0
------	---	---	---	---	---	---	---	---	----	---	---	---	----	---

シロザ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
-----	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
----------	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

シヨクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
-----------	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

野生種のカラスムギ	100	100	100	98	98	90	98	80	100	100	100	40	90	100
-----------	-----	-----	-----	----	----	----	----	----	-----	-----	-----	----	----	-----

アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
--------	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
------	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

ネズミムギ	100	100	100	100	100	65	95	85	100	100	100	95	100	100
-------	-----	-----	-----	-----	-----	----	----	----	-----	-----	-----	----	-----	-----

ダイズ	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	15	0	20	0
-----	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	----	---	----	---

40

シグナルグラス	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	80	95	100
---------	-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----	----	----	-----

イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
-----	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

コムギ	98	98	85	85	60	90	90	50	100	100	100	0	80	95
-----	----	----	----	----	----	----	----	----	-----	-----	-----	---	----	----

セイヨウヌカボ	65	80	80	60	80	20	70	50	100	100	100	35	40	100
---------	----	----	----	----	----	----	----	----	-----	-----	-----	----	----	-----

【表 6 6】

表 B	化合物									
62 g ai/ha	73	74	75	76	78	79	80	81	82	83
出芽後										
オオムギ	70	95	60	25	95	40	98	98	100	45
ギョウギシバ	10	98	90	90	100	100	100	100	100	90
ノスズメノテッポウ	100	100	95	100	100	98	100	100	100	100
ウマノチャヒキ	60	60	50	20	100	50	-	70	100	85
ヒメカナリークサヨシ	100	100	50	98	100	95	100	100	100	90
ハコベ	0	0	0	0	0	0	0	0	90	0
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	20	0
トウモロコシ	100	100	100	100	100	35	100	100	100	100
オニメヒシバ	100	100	60	100	100	98	100	100	100	100
ナルコビエ	100	98	75	90	100	80	100	98	100	100
アキノエノコログサ	100	98	85	98	100	90	100	100	100	100
エノコログサ	100	100	95	100	100	98	100	98	100	100
オヒシバ	90	85	75	75	100	90	98	85	90	60
セイバンモロコシ	100	100	100	98	100	100	100	100	100	100
ホウキギ	0	0	0	0	-	-	-	-	-	0
シロザ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	55	0
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
野生種のカラスムギ	100	100	98	100	100	98	100	100	100	100
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20
ブタクサ	0	0	0	0	60	0	0	20	85	0
ネズミムギ	100	100	98	100	100	90	100	100	100	100
ダイズ	10	0	0	0	25	15	20	20	70	0
シグナルグラス	100	100	85	100	100	85	100	100	100	100
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	55	20
コムギ	95	95	85	35	100	85	98	100	100	95
セイヨウヌカボ	95	100	90	90	80	70	70	95	100	100

表 B	化合物														
31 g ai/ha	1	3	4	5	6	7	11	12	15	16	19	20	21	25	
出芽後															
オオムギ	0	0	0	30	30	-	95	95	10	90	5	0	-	0	
ギョウギシバ	100	100	100	100	100	100	100	100	70	65	100	0	80	60	
ノスズメノテッポウ	20	100	90	95	100	85	100	100	90	98	90	-	100	75	
ウマノチャヒキ	30	5	0	5	5	0	90	85	10	60	75	40	80	10	
ヒメカナリークサヨシ	0	85	80	80	95	90	100	100	35	70	20	50	-	0	

【 0 3 3 9 】

【表 6 7】

ハコベ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0	0	
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
トウモロコシ	10	100	90	90	95	90	100	100	90	98	0	95	100	95	
オニメヒシバ	80	100	100	100	100	100	100	100	90	95	95	85	100	75	
ナルコビエ	95	100	100	95	100	100	100	100	-	80	100	90	100	85	
アキノエノコログサ	100	100	100	100	100	98	100	100	95	85	100	95	100	85	
エノコログサ	95	90	95	95	100	75	100	100	95	95	100	85	100	80	10
オヒシバ	30	95	95	95	95	95	100	100	45	60	80	65	95	0	
セイバンモロコシ	60	0	80	0	0	-	100	100	70	98	100	100	90	0	
ホウキギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
シロザ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
マルバルクウソウ	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	
野生種のカラスムギ	90	90	98	95	100	95	100	100	95	95	100	90	100	70	
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20
ブタクサ	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ネズミムギ	95	95	100	100	100	95	100	100	98	100	100	90	100	85	
ダイズ	0	0	20	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
シグナルグラス	100	100	100	100	100	100	100	100	100	90	100	90	100	95	
イチビ	0	0	5	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
コムギ	45	80	90	90	90	60	100	95	5	95	85	20	90	0	
セイヨウヌカボ	95	80	90	95	90	80	100	100	90	90	100	85	100	60	

表 B

化合物

30

31 g ai/ha

出芽後

オオムギ	0	50	0	30	0	5	15	5	10	40	70	0	-	20	
ギョウギシバ	0	100	100	100	100	100	100	100	100	75	65	25	65	95	
ノズメノテッポウ	80	95	70	80	75	70	50	90	80	95	90	95	95	98	
ウマノチャヒキ	30	10	45	70	50	20	40	55	50	45	80	60	60	70	
ヒメカナリークサヨシ	60	50	10	80	20	5	10	10	10	40	80	0	50	90	
ハコベ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	40
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
トウモロコシ	100	0	0	100	98	100	15	100	100	98	100	95	85	95	
オニメヒシバ	80	80	95	90	95	80	90	85	90	98	98	100	75	90	
ナルコビエ	98	95	100	100	100	100	95	100	100	100	100	100	95	100	
アキノエノコログサ	95	95	98	100	100	100	60	85	50	100	100	100	98	100	
エノコログサ	80	98	90	100	100	95	60	80	80	85	100	100	100	95	
オヒシバ	0	80	70	90	70	70	100	100	100	85	80	85	75	75	

【表 6 8】

セイバンモロコシ	20	75	98	85	98	95	95	95	90	95	98	60	80	98
ホウキギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シロザ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シヨクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
野生種のカラスムギ	90	95	95	95	95	85	60	95	95	100	100	100	100	100
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ネズミムギ	85	55	95	100	95	90	65	98	85	95	100	100	100	100
ダイズ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シグナルグラス	100	70	85	100	100	100	100	100	100	100	100	100	95	100
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	5	85	70	85	40	50	40	80	85	80	98	85	80	90
セイヨウヌカボ	80	50	30	60	60	40	40	65	50	80	90	70	90	100

表 B

化合物

31 g ai/ha	45	48	52	53	54	56	57	59	61	66	67	68	69	72
山芽後														
オオムギ	5	-	0	0	0	50	0	20	90	100	95	0	0	0
ギョウギシバ	98	100	100	100	100	95	98	0	95	100	60	0	95	60
ノスズメノテッポウ	85	85	95	95	70	95	80	90	100	100	100	50	35	98
ウマノチャヒキ	90	60	40	60	50	0	50	5	98	98	80	0	15	30
ヒメカナリークサヨシ	0	90	0	0	0	90	0	55	85	95	95	0	0	30
ハコベ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
トウモロコシ	95	100	98	100	25	95	98	85	100	90	100	30	0	90
オニメヒシバ	100	90	100	90	98	95	98	55	100	98	100	80	98	100
ナルコビエ	100	100	95	100	98	100	100	65	100	100	100	30	95	90
アキノエノコログサ	100	100	100	100	100	98	98	90	100	100	100	65	100	100
エノコログサ	100	100	98	100	95	90	100	90	100	100	98	60	90	100
オヒシバ	80	75	80	65	70	75	85	0	100	85	85	0	75	35
セイバンモロコシ	65	100	90	98	80	85	90	60	100	100	100	0	70	-
ホウキギ	0	0	0	0	0	0	0	0	35	0	0	0	95	0
シロザ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シヨクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
野生種のカラスムギ	100	98	95	95	98	90	95	70	100	100	100	5	90	100
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0

【 0 3 4 1 】

【表 6 9】

ネズミムギ	100	100	95	100	95	60	95	85	100	100	100	80	98	100
ダイズ	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0
シグナルグラス	98	100	100	100	98	98	100	90	100	100	100	80	80	98
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	85	95	70	85	60	80	90	40	98	100	100	0	40	85
セイヨウヌカボ	60	60	60	40	20	20	55	10	100	100	100	0	10	100

表 B

化合物

10

31 g ai/ha 73 74 75 76 78 79 80 81 82 83

出芽後

オオムギ 40 95 15 5 95 30 95 70 100 45

ギョウギシバ 10 95 85 85 100 100 100 100 100 85

ノスズメノテッポウ 100 98 65 100 100 90 95 98 100 95

ウマノチャヒキ 30 50 30 0 95 30 90 50 100 75

ヒメカナリークサヨシ 90 100 0 90 100 85 100 98 100 90

ハコベ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

オナモミ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

トウモロコシ 100 100 90 100 100 20 100 100 100 98

オニメヒシバ 100 98 30 95 100 85 100 100 100 100

ナルコビエ 100 90 65 85 100 75 100 95 95 98

アキノエノコログサ 90 95 80 95 100 85 100 98 100 100

エノコログサ 70 98 80 95 80 98 100 95 100 98

オヒシバ 90 75 60 70 90 85 85 80 85 55

セイバンモロコシ 90 100 98 95 100 100 95 - 100 98

ホウキギ 0 0 0 0 - - - - - 0

シロザ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

マルバルコウソウ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

ショクヨウガヤツリ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

野生種のカラスムギ 100 100 85 100 100 60 100 100 95 100

アオゲイトウ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

ブタクサ 0 0 0 0 0 0 0 0 65 0

ネズミムギ 100 100 95 100 100 80 100 100 100 100

ダイズ 10 0 0 0 20 15 15 15 55 0

シグナルグラス 90 100 75 100 100 75 100 100 100 100

イチビ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

コムギ 90 90 70 30 98 60 95 95 100 90

セイヨウヌカボ 80 100 70 80 60 50 60 85 100 100

20

30

40

【 0 3 4 2 】

【表 7 0】

表 B

化合物

16 g ai/ha

11 12 19 20 21 25 26 28 32 33 34 35 36 37

出芽後

オオムギ	90	80	5	0	60	0	0	0	0	25	0	0	0	0
ギョウギシバ	100	100	100	0	60	0	0	80	65	100	100	65	80	85
ノズメノテッポウ	100	100	85	50	95	40	50	70	35	70	75	60	50	75
ウマノチャヒキ	85	85	75	0	55	0	10	5	10	50	50	20	5	55
ヒメカナリークサヨシ	80	100	20	30	90	0	10	0	10	35	10	0	0	10
ハコベ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
トウモロコシ	100	100	0	90	100	50	0	0	0	95	98	90	15	95
オニメヒシバ	98	100	85	70	100	60	60	75	85	90	80	70	65	70
ナルコビエ	95	100	90	90	100	80	95	55	85	100	90	95	90	98
アキノエノコログサ	100	100	100	90	100	85	95	80	80	100	90	98	35	70
エノコログサ	85	85	100	60	100	70	80	65	60	85	90	75	50	75
オヒシバ	100	100	80	20	80	0	0	75	65	70	55	40	100	100
セイバンモロコシ	100	100	80	75	90	0	0	65	70	70	95	60	50	55
ホウキギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シロザ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
マルババルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
野生種のカラスムギ	100	100	98	90	100	55	90	80	85	95	90	70	50	95
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ネズミムギ	100	100	98	55	100	80	85	55	85	80	85	40	30	90
ダイズ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シグナルグラス	100	100	100	90	100	60	85	65	70	100	80	95	85	100
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	90	90	60	20	85	0	0	40	30	70	40	35	5	50
セイヨウヌカボ	100	100	95	70	98	60	80	35	0	50	10	0	0	60

10

20

30

表 B

化合物

16 g ai/ha

38 39 40 41 43 44 45 48 52 53 54 56 57 59

出芽後

オオムギ	0	5	40	0	50	20	5	0	0	0	0	40	0	0
ギョウギシバ	85	60	60	0	45	90	95	98	98	100	100	70	85	0
ノズメノテッポウ	40	0	90	90	85	90	20	85	70	60	45	65	80	60
ウマノチャヒキ	45	10	60	50	45	60	60	50	30	45	50	0	20	5
ヒメカナリークサヨシ	0	0	30	0	50	90	0	0	0	0	0	85	0	40

40

【表 7 1】

ハコベ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
トウモロコシ	95	85	0	85	85	95	90	95	98	100	0	85	0	85
オニメヒシバ	70	90	98	85	70	65	80	85	85	85	85	85	95	45
ナルコビエ	98	95	98	100	90	98	95	85	90	100	90	100	90	60
アキノエノコログサ	20	98	100	100	98	98	98	95	98	95	98	98	95	85
エノコログサ	75	80	95	100	75	95	95	98	95	95	95	90	95	90
オヒシバ	100	65	75	80	70	60	70	65	65	60	65	65	80	0
セイバンモロコシ	65	55	0	50	0	95	65	75	80	70	25	65	65	0
ハウキギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シロザ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
野生種のカラスムギ	90	95	100	100	100	95	98	95	90	90	90	85	85	60
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ネズミムギ	85	90	100	98	90	95	90	90	80	90	95	40	95	80
ダイズ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シグナルグラス	90	100	100	100	95	100	85	90	85	98	95	75	75	85
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	45	20	70	85	70	90	85	50	50	55	30	65	45	15
セイヨウヌカボ	0	40	80	60	70	85	35	40	0	20	20	0	50	0

表 B

化合物

16 g ai/ha	61	66	67	68	69	72	73	74	75	76	78	79	80	81
出芽後														
オオムギ	90	98	85	0	0	0	40	40	0	0	90	10	60	15
ギョウギシバ	70	98	0	0	65	50	0	85	80	80	98	80	95	95
ノズメノテッポウ	100	100	100	0	35	95	100	95	50	85	95	50	85	90
ウマノチャヒキ	90	95	80	0	0	30	0	40	10	0	85	0	45	45
ヒメカナリークサヨシ	85	90	80	0	0	30	90	90	0	60	90	55	98	-
ハコベ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
トウモロコシ	100	75	90	0	0	90	100	100	50	85	100	0	100	100
オニメヒシバ	100	85	98	60	75	100	70	90	0	85	100	80	100	98
ナルコビエ	100	95	100	0	90	80	98	90	65	65	100	65	95	85
アキノエノコログサ	100	98	95	60	85	100	70	85	70	85	100	80	100	85
エノコログサ	100	100	70	50	80	98	70	95	40	85	60	85	60	90
オヒシバ	100	75	70	0	70	30	90	65	50	60	85	80	75	70

【 0 3 4 4 】

【表 7 2】

セイバンモロコシ	100	100	98	0	65	75	85	98	80	75	100	90	90	95
ホウキギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	-	-	-	-
シロザ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シヨクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
野生種のカラスムギ	100	100	100	0	40	100	95	98	30	95	100	45	100	95
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ネズミムギ	100	100	100	10	55	100	70	100	50	98	98	70	98	90
ダイズ	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	15	0	0	0
シグナルグラス	100	98	85	35	75	95	90	100	70	90	100	70	100	98
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	95	100	100	0	35	85	60	70	20	30	85	20	85	55
セイヨウヌカボ	100	100	100	0	0	100	60	90	50	80	50	50	40	80

10

表 B

化合物

表 B

化合物

20

16 g ai/ha

82 83

16 g ai/ha

82 83

出芽後

出芽後

オオムギ

98 0

ホウキギ

- 0

ギョウギシバ

100 65

シロザ

0 0

ノスズメノテッポウ

98 95

マルバルコウソウ

0 0

ウマノチャヒキ

95 55

シヨクヨウガヤツリ

0 0

ヒメカナリークサヨシ

95 -

野生種のカラスムギ

95 100

ハコベ

0 0

アオゲイトウ

0 0

オナモミ

0 0

ブタクサ

40 0

トウモロコシ

100 95

ネズミムギ

98 98

オニメヒシバ

100 95

ダイズ

45 0

ナルコビエ

90 95

シグナルグラス

95 100

アキノエノコログサ

100 90

イチビ

0 0

エノコログサ

100 65

コムギ

98 55

オヒシバ

65 45

セイヨウヌカボ

100 98

セイバンモロコシ

100 70

30

表 B

化合物

40

8 g ai/ha

19 20 21 25 26 28 32 33 34 35 36 37 38 39

出芽後

オオムギ

0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

ギョウギシバ

80 0 40 0 0 65 60 70 65 40 40 80 40 0

ノスズメノテッポウ

80 30 95 0 0 60 30 70 0 0 0 10 0 0

【 0 3 4 5 】

【表 7 3】

ウマノチャヒキ	10	0	55	0	0	0	5	5	20	0	0	0	30	5	
ヒメカナリークサヨシ	0	5	10	0	10	0	0	0	10	0	0	0	0	0	
ハコベ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
トウモロコシ	0	0	50	0	0	0	0	80	0	40	10	45	90	0	
オニメヒシバ	80	5	95	5	45	60	60	70	70	60	50	70	70	70	
ナルコビエ	90	45	100	60	85	50	75	98	75	80	85	90	70	80	10
アキノエノコログサ	95	80	98	70	80	65	75	100	80	90	0	30	0	80	
エノコログサ	60	20	95	55	60	60	60	85	60	0	0	60	30	30	
オヒシバ	50	5	65	0	0	65	0	50	50	20	0	100	100	20	
セイバンモロコシ	40	30	60	0	0	20	50	70	75	0	0	0	60	40	
ホウキギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
シロザ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20
野生種のカラスムギ	90	50	98	25	85	45	60	90	70	50	0	85	80	95	
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ネズミムギ	80	40	98	60	70	40	5	75	70	40	10	60	10	30	
ダイズ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
シグナルグラス	90	60	100	50	85	65	65	85	70	70	70	95	90	100	
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
コムギ	0	0	50	0	0	20	0	20	0	0	0	15	10	20	
セイヨウヌカボ	90	20	50	40	50	0	0	10	0	0	0	10	0	0	30

表 B

化合物

8 g ai/ha

出芽後

オオムギ	35	-	20	15	5	0	0	0	0	0	0	0	70	90	
ギョウギシバ	0	0	20	65	60	65	40	70	100	65	65	0	55	20	
ノスズメノテツボウ	85	85	85	85	0	40	50	30	45	0	40	0	85	90	
ウマノチャヒキ	50	30	40	40	30	5	30	10	5	0	0	0	80	80	
ヒメカナリークサヨシ	20	-	30	50	0	0	0	0	0	50	0	0	80	40	40
ハコベ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
トウモロコシ	0	85	80	85	85	90	85	20	0	75	0	0	75	65	
オニメヒシバ	70	70	65	60	65	70	65	65	65	65	75	20	98	70	
ナルコビエ	98	95	80	98	85	75	75	85	80	95	65	55	98	90	
アキノエノコログサ	100	100	85	95	90	85	85	85	85	75	80	80	98	85	

【 0 3 4 6 】

【表 7 4】

エノコログサ	85	85	60	75	60	70	80	95	70	50	80	50	95	80
オヒシバ	60	80	60	60	65	15	60	20	55	60	65	0	98	70
セイバンモロコシ	0	50	0	55	60	65	75	35	0	0	15	0	65	75
ハウキギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シロザ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
野生種のカラスムギ	95	100	95	90	90	80	50	80	85	5	85	45	100	95
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ネズミムギ	80	90	80	90	70	40	70	85	75	0	80	80	100	60
ダイズ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0
シグナルグラス	98	100	65	98	75	75	70	75	50	70	65	75	100	95
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	70	80	30	55	60	0	0	5	0	5	30	0	90	95
セイヨウヌカボ	70	30	50	85	30	0	0	0	0	0	50	0	90	90

10

20

表 B

化合物

8 g ai/ha	67	68	69	72	73	74	75	76	78	79	80	81	82	83
出芽後														
オオムギ	35	0	0	0	0	20	0	0	45	0	30	10	90	0
ギョウギシバ	0	0	20	0	0	20	65	70	80	70	85	40	98	40
ノズメノテツボウ	85	0	10	80	60	90	10	70	70	50	80	85	98	70
ウマノチャヒキ	55	0	0	20	0	10	0	0	55	0	40	0	85	10
ヒメカナリークサヨシ	50	0	0	-	30	80	0	45	80	10	90	65	80	65
ハコベ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
トウモロコシ	75	0	0	50	95	98	0	75	40	0	100	45	40	65
オニメヒシバ	70	20	55	95	45	80	0	20	98	75	98	50	100	80
ナルコピエ	90	0	20	55	85	85	20	60	98	60	80	75	85	65
アキノエノコログサ	85	10	60	95	30	80	50	75	98	75	95	80	95	80
エノコログサ	65	10	60	98	40	85	0	65	40	75	50	85	85	60
オヒシバ	65	0	60	30	70	60	30	20	70	60	20	65	60	0
セイバンモロコシ	80	0	60	70	70	98	75	65	75	85	75	75	100	65
ハウキギ	0	0	0	0	0	0	0	0	-	-	-	-	-	0
シロザ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
野生種のカラスムギ	100	0	20	100	70	98	0	80	98	30	85	80	95	98

30

40

【表 7 5】

アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20	0	
ネズミムギ	100	0	10	80	45	98	30	65	90	55	80	85	98	85	
ダイズ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
シグナルグラス	70	35	65	95	60	85	60	65	98	65	95	90	75	85	
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
コムギ	95	0	0	85	5	40	0	10	50	0	35	30	85	40	10
セイヨウヌカボ	95	0	0	85	50	85	10	30	40	0	30	45	70	90	

表 B

化合物

250 g ai/ha	1	2	3	4	5	6	7	15	16	
出芽前										
ギョウギシバ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	
ノズメノテッポウ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	
ウマノチャヒキ	95	-	98	100	100	95	60	98	100	
オナモミ	0	0	0	30	-	0	0	10	0	20
トウモロコシ	100	95	98	100	100	100	100	100	100	
オニメヒシバ	100	100	100	100	100	100	100	100	40	
ナルコビエ	100	100	100	100	100	85	100	98	95	
アキノエノコログサ	100	100	100	100	100	100	100	100	70	
エノコログサ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	
シラホシムグラ	0	100	85	90	90	70	80	100	0	
オヒシバ	100	95	100	100	100	100	100	100	60	
セイバンモロコシ	100	80	100	100	100	100	100	100	100	30
ハウキギ	-	50	30	0	60	60	0	-	-	
シロザ	0	30	-	90	100	95	100	0	-	
マルバルコウソウ	0	0	0	30	0	0	0	-	0	
アメリカイヌホウズキ	0	0	100	80	100	90	100	0	0	
シヨクヨウガヤツリ	0	0	0	-	-	0	0	0	20	
野生種のカラスムギ	98	60	95	95	95	85	85	85	100	
アオゲイトウ	0	70	90	0	100	60	-	0	0	
ブタクサ	0	0	0	0	10	20	20	0	0	40
ロシアアザミ	-	-	-	-	-	-	-	80	0	
ネズミムギ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	
ダイズ	0	0	0	20	-	70	0	30	0	
ヒマワリ	60	0	-	70	0	0	0	60	0	
シグナルグラス	100	100	100	100	100	100	100	100	100	
イチビ	50	10	20	50	0	40	0	0	0	
コムギ	95	75	98	100	98	90	95	80	100	

【表 7 6】

表 B	化合物											
125 g ai/ha	1	2	3	4	5	6	7	11	12	15	16	
出芽前												
ギョウギシバ	100	100	100	100	100	100	90	100	100	100	98	
ノズメノテッポウ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	
ウマノチャヒキ	80	70	95	98	98	65	60	100	75	90	100	
オナモミ	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	
トウモロコシ	100	95	95	98	98	98	98	100	95	100	100	
オニメヒシバ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	20	
ナルコビエ	100	80	90	100	100	85	85	100	100	90	70	
アキノエノコログサ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	40	
エノコログサ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	
シラホシムグラ	0	-	85	85	80	70	80	0	0	10	0	
オヒシバ	100	95	85	100	100	100	100	100	100	90	50	
セイバンモロコシ	100	-	100	100	100	95	100	100	100	98	100	
ホウキギ	20	0	30	0	50	20	0	-	0	-	-	
シロザ	0	0	-	85	90	85	90	0	0	0	-	
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
アメリカイヌホウズキ	0	0	100	-	-	90	100	0	85	0	0	
ショクヨウガヤツリ	-	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	
野生種のカラスムギ	90	-	80	85	80	85	80	100	98	80	98	
アオゲイトウ	0	70	90	-	80	30	100	-	-	0	0	
ブタクサ	0	0	0	0	0	20	0	0	0	0	0	
ロシアアザミ	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	0	
ネズミムギ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	
ダイズ	-	0	0	0	0	40	0	0	0	-	-	
ヒマワリ	0	0	-	0	0	0	0	0	0	-	0	
シグナルグラス	100	-	100	100	100	100	100	100	100	100	95	
イチビ	0	0	0	40	0	0	0	0	0	-	0	
コムギ	90	60	95	100	95	90	80	100	95	60	98	

10

20

30

表 B	化合物														
62 g ai/ha	1	2	3	4	5	6	7	11	12	15	16	19	20	21	
出芽前															
ギョウギシバ	100	100	100	100	100	100	90	100	100	98	0	100	70	100	
ノズメノテッポウ	100	80	100	100	100	100	85	100	100	100	100	100	90	100	
ウマノチャヒキ	80	20	60	70	85	65	35	98	70	55	100	60	0	100	
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
トウモロコシ	95	90	95	95	95	98	95	95	95	98	100	98	95	98	

40

【表 7 7】

オニメヒシバ	100	100	90	100	100	100	100	100	100	100	0	100	60	100
ナルコビエ	100	80	50	85	90	85	70	100	98	85	25	100	98	100
アキノエノコログサ	100	100	98	100	100	100	100	100	100	100	0	100	100	100
エノコログサ	100	95	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
シラホシムグラ	0	100	85	0	-	-	0	0	0	0	0	0	100	90
オヒシバ	50	60	85	100	100	95	90	100	100	90	0	100	70	100
セイバンモロコシ	95	80	95	30	100	90	98	100	100	95	70	100	95	100
ハウキギ	0	0	-	-	50	0	0	-	0	0	-	0	0	0
シロザ	0	0	-	85	-	-	30	-	-	0	-	40	100	100
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0	0	0
アメリカイヌホウズキ	0	0	100	-	0	-	30	0	50	0	0	0	0	-
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
野生種のカラスムギ	85	50	70	70	70	50	70	98	95	70	95	95	60	95
アオゲイトウ	0	0	90	-	0	0	100	-	-	0	0	0	0	0
ブタクサ	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ロシアアザミ	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	0	-	0	0
ネズミムギ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	90	100
ダイズ	-	0	0	0	0	0	-	0	0	0	-	0	-	-
ヒマワリ	0	0	40	0	0	0	0	0	0	0	0	0	40	0
シグナルグラス	100	85	100	100	100	98	100	100	100	100	55	100	100	100
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	45	50	75	95	70	80	65	95	95	60	90	95	0	95

表 B

化合物

62 g ai/ha

出芽前

ギョウギシバ	100	80	100	100	100	100	0	100	100	100	100	100	100	98
ノスズメノテツボウ	90	100	100	-	100	100	98	100	100	100	100	100	100	90
ウマノチャヒキ	0	65	50	50	85	85	75	100	80	60	90	80	90	85
オナモミ	0	10	0	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0
トウモロコシ	75	98	85	90	5	90	95	95	95	90	95	98	95	100
オニメヒシバ	80	95	0	100	100	100	100	98	100	100	100	100	100	100
ナルコビエ	80	100	55	98	100	100	85	100	95	100	100	100	100	98
アキノエノコログサ	100	100	20	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
エノコログサ	98	100	85	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
シラホシムグラ	0	0	-	-	0	50	0	0	0	20	0	0	0	0
オヒシバ	85	95	95	100	100	100	100	98	100	100	100	100	95	100
セイバンモロコシ	0	50	85	100	98	75	90	100	100	80	100	80	80	95
ハウキギ	50	-	-	-	0	0	0	0	0	-	-	0	-	0

【 0 3 5 0 】

【表 7 8】

シロザ	40	0	0	98	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
マルバコウソウ	0	0	0	0	-	0	0	0	0	10	0	0	0	0
アメリカヌホウズキ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
野生種のカラスミギ	60	85	50	90	80	90	80	90	90	95	95	95	90	95
アオゲイトウ	80	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ロシアアザミ	0	0	0	0	0	0	0	80	0	0	80	90	0	0
ネズミミギ	100	100	95	100	100	100	100	98	100	100	100	100	100	100
ダイズ	0	0	0	0	0	60	0	0	0	0	0	0	0	0
ヒマワリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	30	0	0
シグナルグラス	100	100	75	100	95	100	100	100	100	100	100	100	100	100
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0
コムギ	15	0	45	90	10	80	70	80	40	30	60	70	90	80

10

表 B

化合物

20

62 g ai/ha	40	41	43	44	45	46	47	48	50	51	52	53	54	55
出芽前														
ギョウギシバ	100	0	95	0	0	100	100	0	100	100	85	0	0	100
ノズメノテツボウ	95	100	100	100	100	85	100	100	95	100	100	100	90	100
ウマノチャヒキ	90	80	80	85	90	5	90	80	0	85	80	90	85	60
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
トウモロコシ	95	95	100	85	98	0	95	75	90	80	75	60	85	95
オニメシバ	100	20	100	0	0	100	100	0	100	90	0	0	0	100
ナルコビエ	100	75	100	100	0	98	100	0	100	100	0	0	0	100
アキノエノコログサ	100	98	100	0	45	100	100	0	100	100	98	70	55	100
エノコログサ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
シラホシムグラ	0	100	0	0	0	0	-	-	-	0	0	-	0	0
オヒシバ	100	0	100	0	0	100	100	20	100	90	0	0	0	100
セイバンモロコシ	98	95	98	95	98	90	95	80	100	80	85	100	90	95
ホウキギ	0	0	0	100	0	-	-	0	-	-	85	-	-	-
シロザ	0	0	0	0	0	0	65	0	100	0	0	35	0	0
マルバコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	30	0	100	0	0	0
アメリカヌホウズキ	0	0	0	55	0	100	0	20	100	0	0	20	0	100
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
野生種のカラスミギ	95	95	95	90	95	35	70	85	70	90	90	85	95	70
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	100	0	0	0	0	0	0	0	0
ブタクサ	0	0	0	20	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ロシアアザミ	0	0	0	0	-	0	40	0	0	0	0	0	0	0

30

40

【表 7 9】

ネズミムギ	100	100	90	100	100	100	98	100	100	100	100	100	100	100
ダイズ	0	0	0	90	65	0	0	0	100	0	0	65	0	0
ヒマワリ	0	0	0	0	0	0	0	0	20	0	0	0	0	0
シグナルグラス	100	100	100	20	90	0	100	75	98	100	100	95	85	100
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	90	100	80	90	95	0	20	60	0	60	50	55	50	5

表 B

化合物

62 g ai/ha	56	57	58	61	66	67	69	72	74	75	76	78	79	80
出芽前														
ギョウギシバ	100	100	100	95	100	0	0	100	100	98	100	100	100	100
ノズメノテッポウ	98	100	100	100	100	100	70	100	100	90	90	100	100	100
ウマノチャヒキ	75	70	85	95	100	100	0	95	85	80	0	98	80	85
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
トウモロコシ	95	95	80	100	100	100	0	100	98	95	85	100	100	100
オニメヒシバ	100	100	100	100	80	0	0	100	100	55	98	100	100	100
ナルコビエ	100	100	100	100	98	0	85	100	100	75	98	100	100	100
アキノエノコログサ	100	100	100	100	95	0	0	100	100	95	100	100	100	100
エノコログサ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	80	90	100	100	100
シラホシムグラ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
オヒシバ	100	100	100	100	70	60	0	100	100	98	100	100	100	100
セイバンモロコシ	100	100	60	100	100	100	0	100	100	95	85	100	100	100
ホウキギ	100	0	-	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
シロザ	20	65	100	0	-	-	-	40	20	0	0	0	100	0
マルババルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
アメリカイヌホウズキ	20	0	0	0	0	0	0	30	65	0	0	55	0	0
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	0	100	0	0	0	0	0	100	0	0	100
野生種のカラスムギ	90	80	95	100	100	100	40	98	80	50	80	85	95	70
アオゲイトウ	0	0	0	0	95	0	0	50	20	0	0	0	0	55
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	100	10	0	0	0	0	0	0
ロシアアザミ	0	0	60	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ネズミムギ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	98	95	100	100	100
ダイズ	0	0	0	0	0	-	-	0	0	0	0	0	100	0
ヒマワリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シグナルグラス	100	100	100	100	98	55	35	100	100	98	100	100	100	100
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	80	50	80	95	95	100	0	90	85	45	0	95	0	95

10

20

30

40

【表 8 0】

表 B	化合物			表 B	化合物		
62 g ai/ha	81	82	83	62 g ai/ha	81	82	83
出芽前				出芽前			
ギョウギシバ	100	100	100	マルバルコウソウ	100	25	0
ノズメノテッポウ	100	100	98	アメリカイヌホウズキ	50	0	0
ウマノチャヒキ	85	100	30	ショクヨウガヤツリ	0	45	0
オナモミ	0	35	0	野生種のカラスムギ	85	80	85
トウモロコシ	100	98	95	アオゲイトウ	55	0	0
オニメヒシバ	100	100	100	ブタクサ	0	80	0
ナルコビエ	98	100	100	ロシアアザミ	0	0	-
アキノエノコログサ	100	100	100	ネズミムギ	100	100	100
エノコログサ	100	100	100	ダイズ	0	100	0
シラホシムグラ	0	50	0	ヒマワリ	20	85	0
オヒシバ	100	100	100	シグナルグラス	100	100	100
セイバンモロコシ	95	100	98	イチビ	0	75	0
ホウキギ	-	-	100	コムギ	85	100	20
シロザ	0	100	100				

表 B	化合物														
31 g ai/ha	1	2	3	4	5	6	7	11	12	15	16	19	20	21	
出芽前															
ギョウギシバ	100	100	30	100	98	100	60	100	100	98	0	98	0	85	
ノズメノテッポウ	100	60	80	100	100	80	70	100	100	100	100	100	90	100	
ウマノチャヒキ	40	0	50	70	40	50	35	95	0	50	90	30	0	60	
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	
トウモロコシ	90	50	95	85	95	95	90	85	75	50	0	95	80	95	
オニメヒシバ	98	98	90	100	100	98	100	90	100	85	0	100	50	80	
ナルコビエ	85	70	50	85	50	85	70	100	85	60	0	98	50	-	
アキノエノコログサ	100	100	98	100	98	100	100	90	100	90	0	100	50	100	
エノコログサ	100	90	100	100	98	100	100	100	100	100	100	100	100	100	
シラホシムグラ	0	100	-	0	-	0	-	0	0	0	0	0	50	0	
オヒシバ	50	50	80	85	75	80	85	90	98	0	0	100	-	95	
セイバンモロコシ	90	-	80	0	0	60	75	98	95	70	25	100	75	90	
ホウキギ	-	0	0	0	-	0	0	-	0	-	-	-	0	0	
シロザ	0	0	-	-	-	0	30	0	0	0	-	0	100	100	
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
アメリカイヌホウズキ	0	0	90	-	-	0	30	0	0	0	0	-	-	0	
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	

【表 8 1】

野生種のカラスムギ	60	0	60	65	30	50	0	98	90	10	90	95	50	90
アオゲイトウ	-	0	0	-	0	-	85	-	-	0	-	0	0	0
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0
ロシアアザミ	-	-	-	-	-	-	-	-	-	0	0	0	0	0
ネズミムギ	80	75	98	100	100	90	90	100	95	70	100	100	40	-
ダイズ	0	0	0	0	0	0	-	0	0	0	-	-	-	0
ヒマワリ	0	0	30	0	0	0	0	0	0	0	0	0	30	0
シグナルグラス	100	85	100	100	100	98	98	100	100	100	45	98	50	-
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	35	30	45	60	30	35	0	95	90	0	15	90	0	85

10

表 B

化合物

31 g ai/ha	25	26	27	28	30	31	32	33	34	35	36	37	38	39
出芽前														
ギョウギシバ	80	0	100	100	100	100	0	100	98	100	100	100	100	95
ノズメノテッポウ	-	85	50	-	100	98	95	100	100	100	100	100	90	90
ウマノチャヒキ	0	10	50	50	10	65	0	80	55	40	50	60	60	85
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
トウモロコシ	50	70	75	55	5	60	60	90	85	55	70	95	75	98
オニメヒシバ	60	70	0	100	100	100	100	95	100	100	100	100	100	100
ナルコビエ	80	85	30	98	98	100	80	100	95	100	98	50	90	95
アキノエノコログサ	90	100	0	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
エノコログサ	98	100	60	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
シラホシムグラ	0	0	-	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
オヒシバ	75	70	95	100	100	100	98	98	98	100	100	98	95	100
セイバンモロコシ	0	0	75	98	50	75	85	98	100	80	40	80	70	90
ホウキギ	-	-	-	-	0	0	0	0	0	0	-	0	-	0
シロザ	0	0	-	95	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
マルババコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
アメリカイヌホウズキ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シヨクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
野生種のカラスムギ	0	85	50	70	50	70	60	80	85	80	90	80	85	90
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ロシアアザミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0	0
ネズミムギ	90	100	70	100	50	90	100	95	100	100	100	98	95	100
ダイズ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ヒマワリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シグナルグラス	85	100	0	98	90	100	100	98	100	100	100	98	100	100

20

30

40

【表 8 2】

イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	0	0	15	15	0	0	20	50	30	0	5	5	0	70

表 B

化合物

31 g ai/ha	40	41	43	44	45	46	47	48	50	51	52	53	54	55
------------	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----

出芽前

ギョウギシバ	100	0	65	0	0	85	100	0	100	100	0	0	0	100
--------	-----	---	----	---	---	----	-----	---	-----	-----	---	---	---	-----

ノスズメノテッポウ	95	100	100	100	100	40	100	90	60	98	100	100	90	100
-----------	----	-----	-----	-----	-----	----	-----	----	----	----	-----	-----	----	-----

ウマノチャヒキ	80	75	70	60	80	0	0	70	0	45	35	70	70	30
---------	----	----	----	----	----	---	---	----	---	----	----	----	----	----

オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
------	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

トウモロコシ	85	85	85	65	65	0	85	70	-	60	70	55	65	80
--------	----	----	----	----	----	---	----	----	---	----	----	----	----	----

オニメヒシバ	100	0	98	0	0	60	100	0	100	75	0	0	0	100
--------	-----	---	----	---	---	----	-----	---	-----	----	---	---	---	-----

ナルコビエ	100	0	98	0	-	85	100	0	98	90	0	0	0	100
-------	-----	---	----	---	---	----	-----	---	----	----	---	---	---	-----

アキノエノコログサ	100	0	100	0	35	95	100	0	100	100	0	45	20	100
-----------	-----	---	-----	---	----	----	-----	---	-----	-----	---	----	----	-----

エノコログサ	100	100	100	100	100	80	100	100	98	98	100	100	100	100
--------	-----	-----	-----	-----	-----	----	-----	-----	----	----	-----	-----	-----	-----

シラホシムグラ	0	50	0	-	0	0	0	0	-	0	-	-	-	0
---------	---	----	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

オヒシバ	100	0	98	0	0	100	100	0	98	75	0	0	0	98
------	-----	---	----	---	---	-----	-----	---	----	----	---	---	---	----

セイバンモロコシ	98	70	80	0	75	85	85	75	98	70	80	75	75	70
----------	----	----	----	---	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----

ホウキギ	0	0	0	0	0	-	-	0	-	-	-	0	0	-
------	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

シロザ	0	0	0	0	0	0	0	0	100	0	0	0	0	0
-----	---	---	---	---	---	---	---	---	-----	---	---	---	---	---

マルバルコウソウ	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	90	0	0	0
----------	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	----	---	---	---

アメリカイヌホウズキ	0	0	0	0	0	20	0	0	100	0	0	15	0	80
------------	---	---	---	---	---	----	---	---	-----	---	---	----	---	----

シヨクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
-----------	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

野生種のカラスムギ	90	95	95	85	90	0	0	80	40	80	70	80	75	35
-----------	----	----	----	----	----	---	---	----	----	----	----	----	----	----

アオゲイトウ	0	0	0	0	0	60	0	0	0	0	0	0	0	0
--------	---	---	---	---	---	----	---	---	---	---	---	---	---	---

ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
------	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

ロシアアザミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
--------	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

ネズミムギ	95	100	90	90	100	40	90	100	5	100	95	100	90	90
-------	----	-----	----	----	-----	----	----	-----	---	-----	----	-----	----	----

ダイズ	0	0	0	70	-	0	0	0	100	0	-	0	0	0
-----	---	---	---	----	---	---	---	---	-----	---	---	---	---	---

ヒマワリ	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
------	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

シグナルグラス	100	55	100	0	40	0	98	65	90	90	25	60	55	100
---------	-----	----	-----	---	----	---	----	----	----	----	----	----	----	-----

イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
-----	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

コムギ	60	60	15	10	70	0	0	5	0	10	20	0	10	0
-----	----	----	----	----	----	---	---	---	---	----	----	---	----	---

表 B

化合物

31 g ai/ha	56	57	58	61	66	67	69	72	74	75	76	78	79	80
------------	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----

出芽前

ギョウギシバ	100	100	100	90	98	0	0	100	100	65	100	100	100	100
--------	-----	-----	-----	----	----	---	---	-----	-----	----	-----	-----	-----	-----

ノスズメノテッポウ	98	100	100	100	100	100	40	95	100	60	80	100	98	100
-----------	----	-----	-----	-----	-----	-----	----	----	-----	----	----	-----	----	-----

ウマノチャヒキ	45	65	65	95	100	100	0	50	85	50	0	80	55	85
---------	----	----	----	----	-----	-----	---	----	----	----	---	----	----	----

【 0 3 5 5 】

【表 8 3】

オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
トウモロコシ	95	85	55	100	98	100	0	85	90	75	75	100	50	98	
オニメヒシバ	100	98	90	100	60	0	0	80	100	25	55	100	100	100	
ナルコビエ	100	85	100	100	90	0	0	85	98	65	90	100	100	98	
アキノエノコログサ	100	100	100	100	95	0	0	100	100	50	90	100	100	100	
エノコログサ	100	100	100	100	100	100	40	100	100	50	90	100	98	100	
シラホシムグラ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	10
オヒシバ	98	98	95	100	25	0	0	95	100	90	80	100	100	100	
セイバンモロコシ	70	90	40	100	98	100	0	95	90	85	70	95	100	80	
ハウキギ	98	0	-	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	
シロザ	0	20	95	0	-	-	-	30	0	0	0	0	0	20	0
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
アメリカイヌホウズキ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	100	0	0	0	
野生種のカラスムギ	60	70	80	95	95	95	20	95	70	40	5	70	70	60	20
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ブタクサ	0	0	0	0	-	-	100	0	0	0	0	0	0	0	
ロシアアザミ	0	0	20	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ネズミムギ	98	95	100	100	100	100	60	100	100	98	95	100	100	40	
ダイズ	-	0	0	0	0	-	-	0	0	0	0	0	0	98	0
ヒマワリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
シグナルグラス	100	100	98	100	98	0	15	85	100	80	95	100	100	98	
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
コムギ	35	40	40	90	95	100	0	80	25	20	0	90	0	60	30

表 B

化合物

31 g ai/ha

81 82 83

出芽前

ギョウギシバ

100 100 100

ノスズメノテッポウ

100 100 80

ウマノチャヒキ

70 98 20

オナモミ

0 0 0

トウモロコシ

98 98 95

オニメヒシバ

100 100 85

ナルコビエ

95 98 100

アキノエノコログサ

100 100 100

エノコログサ

100 100 80

シラホシムグラ

0 50 0

オヒシバ

100 98 95

表 B

化合物

31 g ai/ha

81 82 83

出芽前

マルバルコウソウ

0 0 0

アメリカイヌホウズキ

0 0 0

ショクヨウガヤツリ

0 0 0

野生種のカラスムギ

70 80 80

アオゲイトウ

0 0 0

ブタクサ

0 50 0

ロシアアザミ

0 0 -

ネズミムギ

100 100 100

ダイズ

0 20 0

ヒマワリ

15 70 0

シグナルグラス

100 95 98

【 0 3 5 6 】

【表 8 4】

セイバンモロコシ	95	98	95	イチビ	0	45	0
ハウキギ	-	-	100	コムギ	50	98	0
シロザ	0	100	100				

表 B

化合物

16 g ai/ha	11	12	19	20	21	25	26	27	28	30	31	32	33	34	
出芽前															
ギョウギシバ	100	100	90	0	80	70	0	0	100	90	100	0	98	98	10
ノズメノテッポウ	100	98	100	-	100	-	-	20	-	60	90	85	100	85	
ウマノチャヒキ	50	0	0	0	50	0	0	0	40	10	0	0	0	55	
オナモミ	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
トウモロコシ	70	70	85	5	80	5	30	0	0	5	0	45	85	65	
オニメシバ	90	100	100	50	80	20	65	0	98	90	90	85	95	100	
ナルコビエ	100	80	85	30	100	40	70	0	30	75	98	70	90	90	
アキノエノコログサ	90	100	100	0	100	60	95	0	98	98	90	95	100	100	
エノコログサ	100	100	100	95	100	98	100	0	100	0	98	100	100	100	20
シラホシムグラ	0	0	-	0	0	0	0	-	-	0	0	0	0	0	
オヒシバ	85	40	75	0	80	50	50	75	100	80	90	98	98	85	
セイバンモロコシ	90	70	100	50	85	0	0	40	85	50	60	75	95	95	
ハウキギ	-	0	0	0	0	0	-	-	-	0	0	0	-	0	
シロザ	0	0	0	20	0	0	0	0	95	0	0	0	0	0	
マルバコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
アメリカイヌホウズキ	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	30
野生種のカラスミギ	80	60	75	0	85	0	80	0	50	50	45	0	80	-	
アオゲイトウ	-	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ブタクサ	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ロシアアザミ	-	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ネズミムギ	90	90	90	35	100	50	90	0	80	10	90	100	95	100	
ダイズ	0	0	-	-	-	0	0	0	-	0	0	0	0	0	
ヒマワリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
シグナルグラス	100	100	80	20	100	85	85	0	65	60	80	75	90	100	40
イチビ	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
コムギ	90	20	10	0	30	0	0	0	5	0	0	0	0	0	

表 B

化合物

16 g ai/ha	35	36	37	38	39	40	41	43	44	45	46	47	48	50
出芽前														
ギョウギシバ	98	100	90	100	90	90	0	0	0	0	20	100	0	100

【 0 3 5 7 】

【表 8 5】

ノズメノテッポウ	85	80	100	-	90	95	100	95	100	98	30	70	90	0
ウマノチャヒキ	40	50	30	55	70	60	70	0	20	50	0	0	0	0
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
トウモロコシ	40	55	40	50	80	75	65	70	55	55	0	20	55	0
オニメシバ	100	98	98	98	100	100	0	65	0	0	0	85	0	98
ナルコビエ	35	85	50	50	65	100	0	60	0	0	0	100	0	75
アキノエノコログサ	100	100	100	98	100	100	0	100	0	0	15	98	0	98
エノコログサ	100	100	98	100	100	100	100	100	98	100	10	80	80	95
シラホシムグラ	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0
オヒシバ	100	100	90	85	100	100	0	75	0	0	100	98	0	80
セイバンモロコシ	80	-	50	-	90	95	65	65	0	20	55	75	60	95
ホウキギ	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	-	-	0	-
シロザ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	65
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
アメリカイヌホウズキ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
野生種のカラスムギ	-	50	65	60	90	85	85	90	80	80	0	0	5	40
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ロシアアザミ	0	0	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0
ネズミムギ	100	98	90	80	95	95	85	90	90	90	10	80	85	0
ダイズ	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0	0	0	50
ヒマワリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シグナルグラス	90	100	85	90	95	100	40	90	0	20	0	95	40	40
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	0	0	0	0	30	60	15	10	0	30	0	0	0	0

10

20

30

表 B

化合物

16 g ai/ha	51	52	53	54	55	56	57	58	61	66	67	69	72	74
出芽前														
ギョウギシバ	100	0	0	0	100	100	100	100	80	85	0	0	100	100
ノズメノテッポウ	98	95	100	90	80	60	100	100	100	100	100	0	90	100
ウマノチャヒキ	0	35	50	0	0	20	0	-	90	85	90	0	30	85
オナモミ	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0
トウモロコシ	-	55	45	0	0	10	60	0	98	70	98	0	80	80
オニメシバ	20	0	0	0	98	60	0	75	95	0	0	0	50	95
ナルコビエ	80	0	0	0	80	80	20	80	98	80	0	0	-	95
アキノエノコログサ	100	0	20	0	98	100	98	95	100	45	0	0	85	98
エノコログサ	90	90	100	95	90	65	100	100	100	100	100	0	100	100

40

【 0 3 5 8 】

【表 8 6】

シラホシムグラ	0	0	-	0	-	0	0	0	-	0	0	0	0	0	
オヒシバ	60	0	0	0	90	80	0	85	100	0	0	0	95	98	
セイバンモロコシ	50	65	65	40	15	65	90	0	95	95	90	0	55	85	
ホウキギ	-	0	-	-	-	20	0	-	-	-	-	-	-	-	
シロザ	-	0	0	0	0	0	0	0	0	-	-	-	0	0	
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
アメリカイヌホウズキ	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	10
シヨクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
野生種のカラスムギ	10	30	65	70	0	50	60	80	90	95	95	0	80	70	
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	-	98	0	0	
ロシアアザミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ネズミムギ	100	95	100	90	70	98	70	100	100	100	100	20	90	98	
ダイズ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	-	-	0	0	
ヒマワリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20
シグナルグラス	75	0	20	0	50	90	98	98	100	80	0	0	85	100	
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
コムギ	0	0	0	0	0	10	15	0	30	90	70	0	35	0	

表 B

化合物

16 g ai/ha	75	76	78	79	80	81	82	83	
出芽前									
ギョウギシバ	0	20	100	100	100	50	100	65	
ノズメノテッポウ	20	40	90	85	70	85	98	30	30
ウマノチャヒキ	20	0	60	0	30	70	50	0	
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	
トウモロコシ	0	55	85	0	85	70	95	45	
オニメヒシバ	0	20	95	100	98	98	98	35	
ナルコピエ	0	75	98	65	65	45	80	90	
アキノエノコログサ	0	70	100	100	100	100	100	100	
エノコログサ	30	65	100	60	98	80	100	70	
シラホシムグラ	0	0	0	0	0	0	-	0	
オヒシバ	65	75	100	100	20	98	98	80	40
セイバンモロコシ	75	0	80	85	65	80	85	85	
ホウキギ	-	-	-	-	-	-	-	100	
シロザ	0	0	0	0	0	0	0	100	
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	
アメリカイヌホウズキ	0	0	0	0	-	0	0	0	
シヨクヨウガヤツリ	0	100	0	0	0	0	0	0	

【 0 3 5 9 】

【表 8 7】

野生種のカラスムギ	0	0	40	0	40	60	60	30
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	-	0
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	20	0
ロシアアザミ	0	0	0	0	0	0	0	-
ネズミムギ	30	75	98	90	40	100	98	85
ダイズ	0	0	0	0	0	0	0	0
ヒマワリ	0	0	0	0	0	0	60	0
シグナルグラス	50	90	95	85	65	85	85	90
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	0	0	80	0	20	5	65	0

10

表 B

化合物

8 g ai/ha	19	20	21	25	26	27	28	30	31	32	33	34	35	36
出芽前														
ギョウギシバ	0	0	60	0	0	-	0	60	95	0	80	50	98	98
ノズメノテッポウ	95	10	95	70	-	-	-	0	80	-	60	0	0	80
ウマノチャヒキ	0	0	0	0	0	0	20	0	0	0	0	0	40	0
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
トウモロコシ	70	0	70	0	15	0	0	0	-	0	50	0	5	40
オニメヒシバ	50	0	0	0	0	0	65	80	80	20	70	100	90	98
ナルコビエ	50	0	60	0	20	0	0	50	70	55	80	55	35	85
アキノエノコログサ	70	0	85	50	65	0	60	60	90	85	100	98	100	100
エノコログサ	85	20	100	50	98	0	30	0	65	70	100	100	30	50
シラホシムグラ	0	0	0	0	0	-	-	0	0	0	0	0	0	0
オヒシバ	0	0	10	0	50	0	80	80	85	60	85	55	80	80
セイバンモロコシ	80	0	0	0	0	0	70	0	55	65	60	65	45	0
ハウキギ	0	-	0	0	0	-	-	0	0	0	0	0	0	-
シロザ	-	0	0	0	0	0	80	0	0	0	0	0	0	0
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
アメリカイヌホウズキ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ショクヨウガヤツリ	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
野生種のカラスムギ	60	0	65	0	-	0	0	50	-	0	70	40	0	0
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ロシアアザミ	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ネズミムギ	50	30	90	50	50	0	0	0	50	90	85	100	100	20
ダイズ	0	-	-	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0
ヒマワリ	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シグナルグラス	80	0	98	50	75	0	0	10	80	70	75	95	45	70

20

30

40

【表 8 8】

イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コムギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0

表 B

化合物

8 g ai/ha 37 38 39 40 41 43 44 45 46 47 48 50 51 52

出芽前

ギョウギシバ 90 60 0 0 0 0 0 0 0 60 0 90 60 0

ノズメノテッポウ 95 90 40 95 95 70 90 - 0 70 80 0 50 0

ウマノチャヒキ 0 55 0 0 70 0 0 0 0 0 0 0 0 0

オナモミ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

トウモロコシ 40 45 65 55 45 0 0 0 0 0 15 0 - 0

オニメヒシバ 70 45 60 45 0 15 0 0 0 0 0 60 0 0

ナルコビエ 50 0 20 15 0 0 - 0 0 98 0 20 0 0

アキノエノコログサ 100 45 100 100 0 95 0 0 0 0 0 20 80 0

エノコログサ 40 30 80 90 100 100 40 100 0 5 30 0 50 90

シラホシムグラ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 - 0 0 0

オヒシバ 75 45 95 98 0 65 0 0 0 70 0 0 0 0

セイバンモロコシ 50 0 75 90 20 20 0 15 - 0 40 70 - 55

ホウキギ 0 0 0 0 0 0 0 0 - - 0 - - 0

シロザ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 - 0

マルバルコウソウ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

アメリカイヌホウズキ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 - 0

ショクヨウガヤツリ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

野生種のカラスムギ 0 0 70 60 70 70 25 15 0 0 0 20 0 0

アオゲイトウ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

ブタクサ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

ロシアアザミ 0 0 0 0 - 0 0 0 0 0 0 0 0 0

ネズミムギ 45 30 90 80 85 90 20 0 0 0 85 0 100 0

ダイズ 0 0 0 0 0 0 0 - 0 0 0 0 0 0

ヒマワリ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

シグナルグラス 65 90 90 80 0 0 0 0 0 80 0 20 30 0

イチビ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

コムギ 0 0 0 5 10 0 0 0 0 0 0 0 0 0

表 B

化合物

8 g ai/ha 53 54 55 56 57 58 61 66 67 69 72 74 75 76

出芽前

ギョウギシバ 0 0 100 85 100 100 55 0 0 0 40 100 - 0

ノズメノテッポウ 95 60 0 40 40 80 40 90 100 0 60 85 0 40

【表 8 9】

ウマノチャヒキ	10	0	0	0	0	0	0	85	50	0	0	30	0	0	10
オナモミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
トウモロコシ	0	0	0	0	0	0	95	0	60	0	70	75	0	0	
オニメヒシバ	0	0	20	0	0	50	50	0	0	0	30	65	0	0	
ナルコビエ	0	0	15	0	0	75	80	0	0	0	70	65	0	55	
アキノエノコログサ	0	0	90	95	98	55	75	0	0	0	70	80	0	0	
エノコログサ	95	55	0	65	70	100	100	98	100	0	25	100	0	40	
シラホシムグラ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
オヒシバ	0	0	55	75	0	70	80	0	0	0	95	95	50	20	
セイバンモロコシ	45	0	0	60	65	0	90	70	70	0	50	70	0	0	
ホウキギ	-	-	-	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	20
シロザ	0	0	0	0	0	0	0	-	-	-	0	0	0	0	
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
アメリカイヌホウズキ	0	0	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	100	
野生種のカラスムギ	40	40	0	0	0	80	40	90	90	0	60	50	0	0	
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	
ロシアアザミ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ネズミムギ	80	20	60	60	0	0	85	100	100	0	75	60	0	75	
ダイズ	0	0	0	0	0	0	0	0	-	-	0	0	0	0	30
ヒマワリ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
シグナルグラス	0	0	15	75	60	95	85	0	0	0	-	100	45	65	
イチビ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
コムギ	0	0	0	0	0	0	20	30	0	0	0	0	0	0	

表 B

化合物

8 g ai/ha	78	79	80	81	82	83
出芽前						
ギョウギシバ	85	90	50	0	90	55
ノスズメノテッポウ	70	85	70	80	80	0
ウマノチャヒキ	40	0	0	20	30	0
オナモミ	0	0	0	0	0	0
トウモロコシ	55	0	20	65	95	0
オニメヒシバ	15	20	0	65	95	0
ナルコビエ	65	20	0	20	45	65
アキノエノコログサ	98	55	0	80	98	80
エノコログサ	100	30	0	40	70	40
シラホシムグラ	0	0	0	0	-	0

40

【 0 3 6 2 】

【表 9 0】

オヒシバ	85	98	0	80	95	55
セイバンモロコシ	60	65	60	60	70	55
ホウキギ	-	-	-	-	-	50
シロザ	0	0	0	0	0	100
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0
アメリカイヌホウズキ	0	0	0	0	0	0
ショクヨウガヤツリ	0	0	0	0	0	0
野生種のカラスムギ	30	0	30	45	0	0
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0
ブタクサ	0	0	0	0	0	0
ロシアアザミ	0	0	0	0	0	-
ネズミムギ	98	0	0	70	40	30
ダイズ	0	0	0	0	0	0
ヒマワリ	0	0	0	0	0	0
シグナルグラス	95	75	0	60	80	55
イチビ	0	0	0	0	0	0
コムギ	0	0	0	0	0	0

10

20

【0363】

テストC

スズメノカタビラ (*Poa annua*)、ノスズメノテッポウ (*Alopecurus myosuroides*)、アブラナ (*brassica rapa*)、ウマノチャヒキ (*Bromus tectorum*)、エノコログサ (*Setaria viridis*)、ネズミムギ (*Lolium multiflorum*)、ヒメカナリークサヨシ (*Phalaris minor*)、アオゲイトウ (*Amaranthus retroflexus*)、春オオムギ (*Hordeum vulgare*)、春コムギ (*Triticum aestivum*)、ノハラガラシ (*Sinapis arvensis*)、野生種のカラスムギ (*Avena fatua*)、セイヨウヌカボ (*Apera spica-venti*)、冬オオムギ (*Hordeum vulgare*)、および冬コムギ (*Triticum aestivum*) から選択した植物種の種子を植えると共に、界面活性剤を含む非植物毒性溶媒混合物中で配合したテスト化学物質で出芽前処理した。同時に、これらの作物および雑草種から選択した植物をいくつかの同一の様式で配合したテスト化学物質の出芽後適用で処理した。出芽後処理について、植物の高さは、2 ~ 18 cm (1 ~ 4 葉ステージ) の範囲であった。

30

40

【0364】

処理済みの植物および対照を制御された成長環境中に15 ~ 25日間にわたって維持し、その後、すべての種を対照と比較すると共に、視覚的に評価した。表C中にまとめられている植物応答評価は0 ~ 100のスケールに基づいており、ここで、0は効果がなく、かつ、100は完全な防除である。ダッシュ (-) 応答はテスト結果が存在しないことを意味する。

【0365】

【表 9 1】

表 C

化合物

16 g ai/ha

11 15 19 20 25 26 37 43 44 53 57

出芽後

春オオムギ

95 0 90 25 0 0 20 35 95 40 20

冬オオムギ

70 0 50 0 0 0 10 15 75 10 15

ノズメノテッポウ

100 95 100 35 35 50 90 98 98 100 75

イチゴツナギ

15 25 0 0 0 0 20 0 0 0 10

ウマノチャヒキ

80 15 65 0 0 0 30 0 40 20 30

ヒメカナリークサヨシ

100 - - 35 0 75 35 75 80 - -

アブラナ

0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

エノコログサ

98 95 100 70 80 95 100 95 95 98 100

ノハラガラシ

25 0 20 0 0 0 0 0 0 0 0

野生種のカラスムギ

100 25 100 98 15 98 80 100 100 90 90

アオゲイトウ

10 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

ネズミムギ

98 100 100 80 60 85 95 98 98 100 98

春コムギ

90 0 80 25 0 10 50 15 95 50 25

冬コムギ

100 0 80 20 0 0 30 25 80 10 30

セイヨウヌカボ

95 0 100 0 0 0 0 60 90 0 0

表 C

化合物

8 g ai/ha

11 15 19 20 25 26 37 43 44 53 57

出芽後

春オオムギ

80 0 20 0 0 0 0 20 60 0 0

冬オオムギ

60 0 20 0 0 0 10 5 20 0 0

ノズメノテッポウ

100 75 75 0 5 50 65 90 90 65 35

イチゴツナギ

0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

ウマノチャヒキ

50 0 40 0 0 0 20 0 15 0 0

ヒメカナリークサヨシ

65 - - 10 0 25 0 65 75 - -

アブラナ

0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

エノコログサ

95 90 95 0 70 90 90 90 50 95 90

ノハラガラシ

0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

野生種のカラスムギ

100 0 100 10 0 70 25 100 100 25 10

アオゲイトウ

0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

ネズミムギ

98 50 60 65 0 70 75 75 90 75 75

春コムギ

65 0 70 0 0 10 15 0 70 5 0

冬コムギ

90 0 20 0 0 0 0 5 75 0 0

セイヨウヌカボ

95 0 80 0 0 0 0 30 50 0 0

【表 9 2】

表 C

化合物

16 g ai/ha

11 15 19 20 25 26 37 43 44 53 57

出芽後

春オオムギ

95 0 90 25 0 0 20 35 95 40 20

冬オオムギ

70 0 50 0 0 0 10 15 75 10 15

ノスズメノテッポウ

100 95 100 35 35 50 90 98 98 100 75

イチゴツナギ

15 25 0 0 0 0 20 0 0 0 10

10

ウマノチャヒキ

80 15 65 0 0 0 30 0 40 20 30

ヒメカナリークサヨシ

100 - - 35 0 75 35 75 80 - -

アブラナ

0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

エノコログサ

98 95 100 70 80 95 100 95 95 98 100

ノハラガラシ

25 0 20 0 0 0 0 0 0 0 0

野生種のカラスムギ

100 25 100 98 15 98 80 100 100 90 90

アオゲイトウ

10 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

ネズミムギ

98 100 100 80 60 85 95 98 98 100 98

20

春コムギ

90 0 80 25 0 10 50 15 95 50 25

冬コムギ

100 0 80 20 0 0 30 25 80 10 30

セイヨウヌカボ

95 0 100 0 0 0 0 60 90 0 0

表 C

化合物

8 g ai/ha

11 15 19 20 25 26 37 43 44 53 57

出芽後

春オオムギ

80 0 20 0 0 0 0 20 60 0 0

冬オオムギ

60 0 20 0 0 0 10 5 20 0 0

30

ノスズメノテッポウ

100 75 75 0 5 50 65 90 90 65 35

イチゴツナギ

0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

ウマノチャヒキ

50 0 40 0 0 0 20 0 15 0 0

ヒメカナリークサヨシ

65 - - 10 0 25 0 65 75 - -

アブラナ

0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

エノコログサ

95 90 95 0 70 90 90 90 50 95 90

ノハラガラシ

0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

野生種のカラスムギ

100 0 100 10 0 70 25 100 100 25 10

40

アオゲイトウ

0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

ネズミムギ

98 50 60 65 0 70 75 75 90 75 75

春コムギ

65 0 70 0 0 10 15 0 70 5 0

冬コムギ

90 0 20 0 0 0 0 5 75 0 0

セイヨウヌカボ

95 0 80 0 0 0 0 30 50 0 0

【 0 3 6 7 】

【表 9 3】

表 C	化合物														
62 g ai/ha	11	15	19	21	25	26	28	30	32	33	34	35	37	41	
出芽前															
春オオムギ	100	65	80	75	0	35	25	50	75	25	70	65	40	90	
冬オオムギ	95	60	80	75	0	10	40	15	65	20	35	50	40	80	
ノスズメノテッポウ	100	98	100	100	75	75	85	98	98	100	85	75	98	100	
イチゴツナギ	30	90	-	-	40	0	50	0	20	0	35	0	70	-	10
ウマノチャヒキ	100	70	95	95	35	20	75	0	60	60	60	60	85	80	
ヒメカナリークサヨシ	100	95	100	100	35	70	90	90	90	90	100	90	95	100	
アブラナ	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0	-	0	0	
エノコログサ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	
ノハラガラシ	0	-	0	0	-	0	0	-	-	-	0	0	0	0	
野生種のカラスムギ	100	65	95	100	40	75	75	40	70	75	75	70	80	95	
アオゲイトウ	15	0	75	0	0	20	0	0	0	0	0	0	0	0	
ネズミムギ	100	100	100	100	75	100	95	75	75	100	100	100	100	100	20
春コムギ	100	70	75	90	0	25	50	20	98	50	90	65	98	95	
冬コムギ	100	25	90	95	0	25	60	0	65	40	60	70	90	98	
セイヨウヌカボ	100	95	100	100	-	100	85	35	75	50	60	80	80	100	

表 C	化合物											
62 g ai/ha	43	44	47	48	51	52	53	54	55	57	58	
出芽前												
春オオムギ	60	75	75	80	70	60	75	70	70	40	75	30
冬オオムギ	65	75	40	70	40	50	50	75	60	60	75	
ノスズメノテッポウ	100	100	100	98	100	95	98	100	95	95	100	
イチゴツナギ	25	0	50	0	10	10	65	25	15	65	0	
ウマノチャヒキ	75	80	35	40	50	80	85	80	40	80	75	
ヒメカナリークサヨシ	95	85	90	95	90	95	95	95	90	90	95	
アブラナ	0	0	-	-	-	-	0	-	-	0	-	
エノコログサ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	
ノハラガラシ	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
野生種のカラスムギ	98	90	80	70	50	60	85	70	65	80	75	40
アオゲイトウ	20	20	0	0	0	0	0	0	-	0	0	
ネズミムギ	98	100	100	100	90	100	100	100	90	100	100	
春コムギ	65	75	65	75	75	90	85	98	60	90	90	
冬コムギ	70	70	65	70	40	65	70	50	60	65	80	
セイヨウヌカボ	100	100	65	80	80	70	90	75	60	75	70	

【表 9 4】

表 C

化合物

3l g ai/ha	11	15	19	21	25	26	28	30	32	33	34	35	37	41
出芽前														
春オオムギ	70	40	65	60	0	25	15	30	25	10	0	20	15	75
冬オオムギ	75	50	75	50	0	10	0	0	20	0	10	0	20	70
ノスズメノテッポウ	90	95	100	100	75	-	15	90	75	80	75	75	90	100
イチゴツナギ	-	75	-	-	40	0	-	0	0	0	0	0	60	-
ウマノチャヒキ	70	35	75	75	20	0	20	0	20	35	10	50	60	50
ヒメカナリークサヨシ	98	80	98	90	10	65	10	65	75	65	65	50	80	98
アブラナ	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0	-	0	0
エノコログサ	100	100	100	100	100	75	100	80	100	100	100	40	100	100
ノハラガラシ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0	0	0
野生種のカラスムギ	98	50	80	95	40	65	20	30	65	60	70	30	70	95
アオゲイトウ	0	0	50	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ネズミムギ	100	100	100	100	60	100	90	60	-	100	100	98	98	100
春コムギ	75	35	60	60	0	25	35	0	60	20	50	50	90	75
冬コムギ	100	20	60	60	0	0	30	0	35	15	25	25	25	60
セイヨウヌカボ	100	75	100	100	-	98	75	-	0	-	20	15	60	100

10

20

表 C

化合物

3l g ai/ha	43	44	47	48	51	52	53	54	55	57	58
出芽前											
春オオムギ	35	60	35	30	20	40	40	25	0	20	10
冬オオムギ	50	75	40	0	0	0	50	15	0	20	0
ノスズメノテッポウ	98	100	90	65	100	95	98	100	80	95	98
イチゴツナギ	-	0	50	0	0	10	40	0	0	50	0
ウマノチャヒキ	40	50	35	0	0	15	80	15	0	40	70
ヒメカナリークサヨシ	75	75	50	85	80	90	95	80	20	80	90
アブラナ	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-
エノコログサ	100	100	80	100	100	100	100	100	100	100	100
ノハラガラシ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	-
野生種のカラスムギ	80	80	75	50	35	60	75	40	0	60	65
アオゲイトウ	0	20	0	0	0	0	0	0	0	0	-
ネズミムギ	98	100	80	90	-	90	100	100	-	100	100
春コムギ	30	70	25	60	60	65	85	65	50	65	60
冬コムギ	20	-	35	20	0	40	50	35	0	20	60
セイヨウヌカボ	80	100	30	35	20	70	75	60	0	50	50

30

40

【表 9 5】

表 C	化合物														
16 g ai/ha	11	15	19	21	25	26	28	30	32	33	34	35	37	41	
出芽前															
春オオムギ	30	0	65	35	0	0	15	0	0	0	0	0	0	65	
冬オオムギ	40	20	40	40	0	0	0	0	0	0	0	-	0	25	
ノスズメノテッポウ	90	80	100	98	50	50	5	20	-	50	20	30	75	100	
イチゴツナギ	20	60	0	0	35	0	0	0	0	0	0	0	35	0	
ウマノチャヒキ	65	20	65	40	20	0	0	0	20	35	0	0	0	50	
ヒメカナリークサヨシ	75	70	90	75	0	0	0	0	0	10	20	0	60	80	
アブラナ	0	0	0	0	0	-	0	0	-	0	0	-	-	0	
エノコログサ	100	98	100	100	25	0	20	25	75	95	100	-	90	100	
ノハラガラシ	0	0	0	0	0	0	0	-	0	-	0	-	0	-	
野生種のカラスムギ	98	-	65	75	15	15	0	0	10	25	0	0	20	75	
アオゲイトウ	0	0	30	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0	
ネズミムギ	98	100	100	100	30	75	15	30	20	65	100	35	80	100	
春コムギ	60	10	40	40	0	0	0	0	25	0	0	20	0	50	
冬コムギ	40	0	50	50	0	0	10	0	20	0	10	10	15	40	
セイヨウヌカボ	100	25	100	100	75	30	30	-	0	0	0	-	20	98	

10

20

表 C	化合物											
16 g ai/ha	43	44	47	48	51	52	53	54	55	57	58	
出芽前												
春オオムギ	20	60	20	15	15	0	0	0	0	0	0	
冬オオムギ	20	50	20	0	0	0	15	10	0	0	0	
ノスズメノテッポウ	90	25	0	50	35	60	75	70	40	85	65	
イチゴツナギ	0	0	20	0	0	0	20	0	0	30	0	
ウマノチャヒキ	25	20	15	0	0	0	20	0	0	20	15	
ヒメカナリークサヨシ	65	65	0	0	0	65	0	70	0	75	60	
アブラナ	-	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	
エノコログサ	100	90	15	95	80	100	90	98	40	100	98	
ノハラガラシ	0	0	0	-	0	0	-	0	0	0	0	
野生種のカラスムギ	70	75	0	0	0	40	0	0	0	15	50	
アオゲイトウ	0	20	0	0	0	0	0	0	0	0	-	
ネズミムギ	98	100	20	40	90	65	100	20	0	85	65	
春コムギ	0	20	15	35	0	0	20	25	0	20	50	
冬コムギ	0	65	20	0	0	0	0	0	0	15	0	
セイヨウヌカボ	25	100	0	0	10	0	30	0	0	0	20	

30

40

【 0 3 7 0 】

【表 9 6】

表 C	化合物														
8 g ai/ha	11	15	19	21	25	26	28	30	32	33	34	35	37	41	
出芽前															
春オオムギ	20	0	50	20	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
冬オオムギ	20	0	20	20	0	0	0	0	0	0	0	0	0	10	
ノスズメノテッポウ	85	70	80	95	0	20	0	0	—	0	0	0	35	100	
イチゴツナギ	0	40	—	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ウマノチャヒキ	35	0	30	0	20	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ヒメカナリークサヨシ	15	20	65	65	0	0	0	0	0	0	0	0	15	50	
アブラナ	0	0	0	0	0	—	0	0	—	0	0	—	0	0	
エノコログサ	100	60	20	50	15	0	0	10	40	15	30	15	75	98	
ノハラガラシ	0	0	0	0	0	0	0	—	0	—	—	—	0	0	
野生種のカラスムギ	98	0	65	65	15	0	0	0	0	0	0	0	20	65	
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	—	0	0	0	0	
ネズミムギ	85	15	80	98	25	15	0	0	0	10	30	0	0	100	
春コムギ	50	0	0	30	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
冬コムギ	20	0	10	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
セイヨウヌカバ	100	—	100	100	50	30	20	—	0	0	0	0	0	65	

10

20

表 C	化合物											
8 g ai/ha	43	44	47	48	51	52	53	54	55	57	58	
出芽前												
春オオムギ	0	0	10	0	0	0	0	0	0	0	0	
冬オオムギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ノスズメノテッポウ	85	-	0	35	0	40	70	35	-	75	0	
イチゴツナギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ウマノチャヒキ	10	0	0	0	0	0	10	0	0	0	0	
ヒメカナリークサヨシ	50	30	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
アブラナ	0	0	-	-	-	-	-	-	-	0	-	
エノコログサ	75	15	0	35	10	75	90	40	20	40	35	
ノハラガラシ	0	0	0	-	-	0	0	-	0	0	0	
野生種のカラスムギ	35	50	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
アオゲイトウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ネズミムギ	60	90	0	40	0	0	25	0	0	65	25	
春コムギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20	0	
冬コムギ	0	40	0	0	0	0	0	0	0	15	0	
セイヨウヌカバ	-	100	0	0	0	0	0	0	0	0	0	

30

40

【0 3 7 1】

テスト D

各施用量のための3つのプラスチックポット(約16-cm径)に、35:50:15比の砂、シルトおよびクレイ、ならびに、2.6%有機物を含む、滅菌したTamaシルト質壤土を部分的に入れた。3つのポットの各々についての個別の栽植は以下のとおりで

50

あった。アメリカコナギ (*Heteranthera limosa*)、タマガヤツリ (*Cyperus difformis*) およびホソバヒメミソハギ (*Ammannia coccinea*) の米国製の種子を、各割合で1つの16 - cmポットに植えた。コゴメガヤツリ (*Cyperus iria*)、オニアゼガヤ (*Leptochloa fascicularis*)、9または10本の湛水直播水稻苗 (*Oryza sativa* cv. 'Japonica - M202') の一植分、および、6本の移植イネ苗 (*Oryza sativa* cv. 'Japonica - M202') の一植分の米国製の種子を、各割合で1つの16 - cmポットに植えた。イヌビエ (*Echinochloa crus-galli*)、ヒメタイヌビエ (*Echinochloa oryzicola*)、タイヌビエ (*Echinochloa oryzoides*)、および、コヒメビエ (*Echinochloa colona*) の米国からの種子を、各割合で1つの16 - cmポットに植えた。栽植は、処理時に作物および雑草種が2.0 ~ 2.5葉ステージであるように順次であった。

【0372】

ポットの植物は30 / 27 の昼間 / 夜間温度設定の温室内で成長させ、追加的にバランスをとった照明で、16時間の日長を維持した。テストポットは、テストが完了するまで温室中に維持した。

【0373】

処理時に、テストポットは土壌表面上3 cmに湛水し、テスト化合物の田面水への直接的な適用により処理し、次いで、テストの間はこの水深を維持した。イネおよび雑草に対する処理の効果を、21日間の後に、未処理の対照と比較することにより視覚的に評価した。表D中にまとめられている植物応答評価は0 ~ 100のスケールに基づいており、ここで、0は効果がなく、かつ、100は完全な防除である。ダッシュ (-) 応答はテスト結果が存在しないことを意味する。

【0374】

【表 9 7】

表 D	化合物	表 D	化合物	
250 g ai/ha	21 43	125 g ai/ha	21 43	
湛水		湛水		
イヌビエ	100 100	イヌビエ	100 100	
アメリカコナギ	0 0	アメリカコナギ	0 0	
コゴメガヤツリ	70 0	コゴメガヤツリ	70 0	
コヒメビエ	100 100	コヒメビエ	100 100	10
ホソバヒメミソハギ	0 0	ホソバヒメミソハギ	0 0	
移植イネ	65 35	移植イネ	50 10	
湛水直播水稻	75 35	湛水直播水稻	65 30	
タマガヤツリ	0 0	タマガヤツリ	0 0	
オニアゼガヤ	100 20	オニアゼガヤ	100 0	
タイヌビエ	100 100	タイヌビエ	100 70	
ヒメタイヌビエ	100 100	ヒメタイヌビエ	100 65	20
表 D	化合物	表 D	化合物	
64 g ai/ha	21 43	32 g ai/ha	21 43	
湛水		湛水		
イヌビエ	100 60	イヌビエ	60 20	
アメリカコナギ	0 0	アメリカコナギ	0 0	
コゴメガヤツリ	70 0	コゴメガヤツリ	0 0	
コヒメビエ	100 60	コヒメビエ	70 0	
ホソバヒメミソハギ	0 0	ホソバヒメミソハギ	0 0	
移植イネ	0 0	移植イネ	0 0	30
湛水直播水稻	35 0	湛水直播水稻	20 0	
タマガヤツリ	0 0	タマガヤツリ	0 0	
オニアゼガヤ	80 0	オニアゼガヤ	30 0	
タイヌビエ	65 60	タイヌビエ	40 0	
ヒメタイヌビエ	60 30	ヒメタイヌビエ	30 0	
表 D	化合物	表 D	化合物	
16 g ai/ha	21 43	16 g ai/ha	21 43	40
湛水		湛水		
イヌビエ	0 0	湛水直播水稻	0 0	
アメリカコナギ	0 0	タマガヤツリ	0 0	
コゴメガヤツリ	0 0	オニアゼガヤ	30 0	
コヒメビエ	0 0	タイヌビエ	0 0	
ホソバヒメミソハギ	0 0	ヒメタイヌビエ	0 0	
移植イネ	0 0			

テスト E

ギョウギシバ (*Cynodon dactylon*)、シグナルグラス (*Brachia-
ria decumbens*)、オニメヒシバ (*Digitaria sanguin-
alis*)、エノコログサ (*Setaria viridis*)、オヒシバ (*Eleus-
ine indica*)、セイバンモロコシ (*Sorghum halepense*)、
ハウキギ (*Kochia scoparia*)、マメアサガオ (*Ipomoea lac-
unosa*)、ハマスゲ (*Cyperus rotundus*)、ブタクサ (*Ambro-
sia elatior*)、クロガラシ (*Brassica nigra*)、ギネアキビ
(*Panicum maximum*)、シマスズメノヒエ (*Paspalum dila-
tatum*)、イヌビエ (*Echinochloa crus-galli*)、シンクリ 10
ノイガ (*Cenchrus echinatus*)、ノゲシ (*Sonchus oler-
aceus*)、アメリカキンゴジカ (*Sida spinosa*)、ネズミムギ (*Lol-
ium multiflorum*)、スベリヒユ (*Portulaca olerace-
a*)、メリケンクキビ (*Brachiararia platyphylla*)、ノボロギ
ク (*Senecio vulgaris*)、ハコベ (*Stellaria media*)
、バージニアデイフラワー (*Virginia dayflower*) (*Commeli-
na virginica*)、マルバツユクサ (*Commelina benghale-
nsis*)、スズメノカタビラ (*Poa annua*)、メヒシバの一種 (naked
crabgrass) (*Digitaria nuda*)、ツノアイアシ (*Rottbo-
ellia cochinchinensis*)、シバムギ (*Elytrigia re-
pens*)、ヒメムカシヨモギ (*Conyza canadensis*)、セイヨウヒル 20
ガオ (*Convolvulus arvensis*)、コバノセンダングサ (*Biden-
s bipinnata*)、ウスベニアオイ (*Malva sylvestris*) およ
びロシアアザミ (*Salsola kali*) から選択した植物種の種子を植えると共に
、界面活性剤を含む非植物毒性溶媒混合物中で配合したテスト化学物質で出芽前処理した
。同時に、これらの雑草種から選択した植物を、いくつかの同一の様式で配合したテスト
化学物質で、出芽後適用で処理した。出芽後処理について、植物の高さは、2 ~ 18 cm
(1 ~ 4 葉ステージ) の範囲であった。

【0376】

処理済みの植物および対照を、14 ~ 21 日間にわたって温室中に維持した、その後、 30
すべての種を対照と比較すると共に、視覚的に評価した。表 E 中にまとめられている植物
応答評価は 0 ~ 100 のスケールに基づいており、ここで、0 は効果がなく、かつ、10
0 は完全な防除である。ダッシュ (-) 応答はテスト結果が存在しないことを意味する。

【0377】

【表 9 8】

表 E

化合物

62 g ai/ha

出芽後

イヌビエ

ギョウギシバ

クロガラシ

イチゴツナギ

ハコベ

オニメヒシバ

メヒシバの一種

シマスズメノヒエ

バージニアデイフラワー

エノコログサ

オヒシバ

ノボロギク

ギネアキビ

ツノアイアシ

セイバンモロコシ

ウスベニアオイ

マルバルコウソウ

アメリカキンゴジカ

ハマスゲ

スベリヒユ

シバムギ

ネズミムギ

シンクリノイガ

メリケンニクキビ

21	31	32	33	34	35	36	39	40	43	53	54
100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
75	95	75	95	95	90	90	65	70	20	98	80
0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
15	10	0	5	0	0	0	0	15	0	0	0
-	-	-	-	-	-	-	0	-	-	-	-
98	80	80	95	100	80	80	98	95	80	100	100
100	90	90	98	100	95	98	98	100	100	100	90
98	70	40	65	70	60	50	75	95	50	75	80
-	-	0	-	0	-	-	-	-	0	0	0
100	75	90	95	98	75	75	95	98	98	100	98
98	75	80	75	80	75	75	95	95	90	95	95
0	-	0	0	0	-	-	0	-	0	0	-
100	90	100	95	100	95	90	95	100	100	100	100
75	70	90	75	95	70	60	60	80	75	98	100
100	100	100	98	100	98	95	95	98	-	100	100
0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
0	0	50	0	30	0	0	0	0	0	30	0
-	-	0	-	0	-	-	-	-	0	0	0
0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
80	50	0	70	40	40	35	60	95	75	30	35
100	90	98	95	100	95	80	100	100	100	100	100
100	75	80	90	100	75	85	100	100	100	100	95
100	75	100	100	100	100	100	100	100	98	100	100

10

20

30

【 0 3 7 8 】

【表 9 9】

ノゲシ	-	-	0	-	0	-	-	-	-	0	0	0
マルバツユクサ	0	0	-	0	-	0	0	0	0	-	-	-
シグナルグラス	100	75	100	100	100	90	100	100	100	98	100	100

表 E

化合物

31 g ai/ha	11	12	19	21	31	32	33	34	35	36	39	40	43	53
出芽後														
イヌビエ	100	100	100	100	75	100	100	100	100	95	100	100	100	100
ギョウギンバ	95	95	80	65	90	40	90	80	80	70	50	60	20	80
クロガラシ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
イチゴツナギ	0	0	0	10	0	0	5	0	0	0	0	15	0	0
ハコベ	0	0	-	0	0	-	0	-	0	-	0	0	-	-
オニメヒシバ	100	95	80	95	75	75	90	100	75	75	95	90	80	95
メヒシバの一種	98	95	98	98	75	80	90	-	95	90	80	95	-	98
シマスズメノヒエ	90	85	75	85	60	30	65	20	50	30	75	80	20	30
バージニアディフラー	0	0	0	-	-	0	-	0	-	-	-	-	0	0
セイヨウヒルガオ	0	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
エノコログサ	100	100	100	95	70	85	75	95	65	75	75	95	80	90
オヒシバ	85	90	75	90	70	60	75	80	40	40	80	80	75	80
ノボロギク	0	0	0	-	-	0	0	0	-	-	0	-	0	0
ギネアキビ	98	95	98	100	85	98	90	100	80	90	90	95	100	100
ヒメムカシヨモギ	0	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
ツノアイアシ	98	95	80	75	65	90	70	95	70	50	40	80	20	95
セイバンモロコシ	100	95	100	85	75	98	98	98	70	75	75	90	65	100
ホウキギ	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
ウスベニアオイ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	35	0	0	0	0	0	0	0	0
アメリカキンゴジカ	0	0	0	-	-	0	-	0	-	-	-	-	0	0
ハマスゲ	-	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
スベリヒユ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0
シバムギ	95	95	80	40	30	0	60	30	30	30	60	70	20	0
ブタクサ	0	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
ネズミムギ	95	100	100	100	50	95	90	100	60	60	98	100	100	100
シンクリノイガ	100	100	100	95	75	80	80	90	75	80	95	95	98	95
メリケンニクキビ	100	100	98	100	75	95	95	95	75	90	95	95	95	95
ノゲシ	0	0	0	-	-	0	-	0	-	-	-	-	0	0
コバノセンダングサ	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
マルバツユクサ	-	-	-	0	0	-	-	-	0	0	0	0	-	-
シグナルグラス	100	98	100	100	50	100	100	100	80	80	100	100	98	100

10

20

30

40

【表 1 0 0】

表 E	化合物	表 E	化合物	
31 g ai/ha	54	31 g ai/ha	54	
出芽後		出芽後		
イヌビエ	100	セイバンモロコシ	100	
ギョウギシバ	40	ホウキギ	-	
クロガラシ	0	ウスベニアオイ	0	
イチゴツナギ	0	マルバルコウソウ	0	10
ハコベ	-	アメリカキンゴジカ	0	
オニメヒシバ	95	ハマスゲ	0	
メヒシバの一種	90	スベリヒユ	0	
シマスズメノヒエ	40	シバムギ	0	
バージニアディフラワー	0	ブタクサ	-	
セイヨウヒルガオ	-	ネズミムギ	100	
エノコログサ	80	シンクリノイガ	90	
オヒシバ	50	メリケンニクキビ	98	20
ノボロギク	0	ノゲシ	0	
ギネアキビ	95	コバノセンダングサ	-	
ヒメムカシヨモギ	-	マルバツユクサ	-	
ツノアイアシ	95	シグナルグラス	100	

表 E	化合物														
16 g ai/ha	11	19	21	31	32	33	34	35	36	39	40	43	53	54	
出芽後															
イヌビエ	100	100	100	70	98	100	100	75	50	100	100	100	100	98	30
ギョウギシバ	80	35	50	75	20	80	50	65	40	40	50	20	70	20	
クロガラシ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
イチゴツナギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
ハコベ	0	-	-	0	-	0	-	0	0	0	0	-	-	-	
オニメヒシバ	95	60	90	65	75	75	75	60	70	90	85	60	95	80	
メヒシバの一種	95	90	90	65	-	90	80	50	60	80	75	65	80	85	
シマスズメノヒエ	90	60	80	40	20	35	20	30	20	70	75	-	20	30	
バージニアディフラワー	0	0	-	-	0	-	0	-	-	-	-	0	0	0	40
セイヨウヒルガオ	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	
エノコログサ	98	95	75	60	60	65	75	60	50	70	80	80	80	70	
オヒシバ	80	60	80	50	35	35	20	30	35	70	65	75	65	0	
ノボロギク	0	0	-	0	0	0	0	0	-	-	-	0	0	0	
ギネアキビ	98	95	98	80	98	80	95	75	75	80	90	100	98	95	
ヒメムカシヨモギ	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	

【 0 3 8 0】

【表 1 0 1】

ツノアイアシ	85	70	65	60	75	65	80	40	40	25	40	-	90	90
セイバンモロコシ	100	100	65	60	80	75	80	50	50	75	60	25	100	60
ホウキギ	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
ウスベニアオイ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
マルバルコウソウ	0	0	0	0	35	0	0	0	0	0	0	0	0	0
アメリカキンゴジカ	0	0	-	-	0	-	0	-	-	-	-	0	0	0
ハマスゲ	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
スベリヒユ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シバムギ	90	75	35	30	0	30	0	10	0	30	50	0	0	0
ブタクサ	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
ネズミムギ	95	100	98	35	95	75	95	20	35	98	90	80	100	80
シンクリノイガ	100	98	80	70	75	75	75	75	65	85	85	95	80	80
メリケンニクキビ	90	98	90	65	80	75	85	70	50	95	90	80	95	90
ノゲシ	0	0	-	-	0	-	0	-	-	-	-	0	0	0
コバノセンダングサ	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
マルバツユクサ	-	-	0	0	-	0	-	0	0	0	0	-	-	-
シグナルグラス	100	95	95	50	-	75	98	75	65	100	90	98	90	90

10

20

表 E

化合物

8 g ai/ha	11	12	19	21	31	32	33	34	35	36	39	40	43	53
出芽後														
イヌビエ	100	100	98	100	35	98	95	95	60	50	100	100	100	100
ギョウギシバ	35	70	35	40	65	5	70	20	35	40	35	30	0	50
クロガラシ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
イチゴツナギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ハコベ	0	0	-	-	0	-	0	-	0	0	0	0	-	-
オニメヒシバ	70	65	40	80	60	35	70	60	50	65	65	75	30	35
メヒシバの一種	90	90	85	80	30	60	75	40	50	40	65	50	65	30
シマスズメノヒエ	75	75	30	75	35	0	35	10	30	0	60	65	0	0
バージニアディフラワー	0	0	0	-	-	0	-	0	-	-	-	-	0	0
セイヨウヒルガオ	0	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
エノコログサ	90	90	90	65	50	40	60	50	40	35	60	70	75	70
オヒシバ	35	30	25	75	35	35	35	0	30	0	35	65	20	20
ノボロギク	0	0	0	0	0	0	0	0	0	-	-	-	0	0
ギネアキビ	95	95	90	95	75	90	80	95	75	35	80	80	100	90
ヒメムカシヨモギ	0	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
ツノアイアシ	75	50	20	50	50	30	40	70	30	0	20	40	20	70
セイバンモロコシ	100	95	90	50	40	50	50	10	40	35	35	60	15	50
ホウキギ	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-

30

40

【 0 3 8 1 】

【表 1 0 2】

ウスベニアオイ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
アメリカキンゴジカ	0	0	0	-	-	0	-	0	-	-	-	-	0	0
ハマスゲ	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
スベリヒユ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シバムギ	65	30	15	20	0	0	0	0	0	0	0	30	0	0
ブタクサ	0	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
ネズミムギ	90	100	90	80	30	75	35	60	20	0	75	90	50	80
シンクリノイガ	95	98	98	80	0	60	65	75	40	40	75	75	80	65
メリケンニクキビ	90	80	80	80	65	80	75	75	60	10	35	75	80	90
ノゲシ	0	0	0	-	-	0	-	0	-	-	-	-	0	0
コバノセンダングサ	0	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
マルバツユクサ	-	-	-	0	0	-	0	-	0	0	0	0	-	-
シグナルグラス	80	90	70	95	20	80	75	90	70	65	95	90	95	90

10

表 E	化合物	表 E	化合物
8 g ai/ha	54	4 g ai/ha	11 12 19
出芽後		出芽後	
イヌビエ	95	イヌビエ	90 90 90
ギョウギシバ	10	ギョウギシバ	10 15 15
クロガラシ	0	クロガラシ	0 0 0
イチゴツナギ	0	イチゴツナギ	0 0 0
ハコベ	-	ハコベ	0 0 0
オニメヒシバ	25	オニメヒシバ	60 0 30
メヒシバの一種	10	メヒシバの一種	25 50 40
シマスズメノヒエ	20	シマスズメノヒエ	60 65 0
バージニアデイフラワー	0	バージニアデイフラワー	0 0 0
セイヨウヒルガオ	-	セイヨウヒルガオ	0 0 0
エノコログサ	40	エノコログサ	60 30 20
オヒシバ	0	オヒシバ	10 10 0
ノボロギク	0	ノボロギク	0 0 0
ギネアキビ	95	ギネアキビ	90 95 80
ヒメムカシヨモギ	-	ヒメムカシヨモギ	0 0 0
ツノアイアシ	10	ツノアイアシ	0 0 0
セイバンモロコシ	20	セイバンモロコシ	95 95 90
ホウキギ	-	ホウキギ	0 0 0
ウスベニアオイ	0	ウスベニアオイ	0 0 0
マルバルコウソウ	0	マルバルコウソウ	0 0 0
アメリカキンゴジカ	0	アメリカキンゴジカ	0 0 0

20

30

40

【表 103】

ハマスゲ	0	ハマスゲ	0	0	0	
スベリヒユ	0	スベリヒユ	0	0	0	
シバムギ	0	シバムギ	40	20	0	
ブタクサ	-	ブタクサ	0	0	0	
ネズミムギ	80	ネズミムギ	75	75	50	
シンクリノイガ	60	シンクリノイガ	90	90	90	
メリケンニクキビ	75	メリケンニクキビ	90	65	65	10
ノゲシ	0	ノゲシ	0	0	0	
コバノセンダングサ	-	コバノセンダングサ	0	0	0	
マルバツユクサ	-	シグナルグラス	25	35	35	
シグナルグラス	90					

表 E

化合物

62 g ai/ha	21	31	33	34	35	36	39	40	43	53	
出芽前											
イヌビエ	100	90	100	100	100	100	100	100	100	100	20
ギョウギシバ	100	100	100	100	100	100	100	100	85	98	
クロガラシ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	25	
イチゴツナギ	0	0	0	15	0	0	0	95	0	60	
ハコベ	-	-	-	-	-	-	-	-	0	0	
オニメヒシバ	100	95	100	100	100	98	100	100	80	100	
メヒシバの一種	100	100	100	100	100	100	100	100	75	100	
シマスズメノヒエ	100	98	100	85	90	98	100	100	90	95	
バージニアディフラワー	-	-	-	0	-	-	-	-	0	0	30
エノコログサ	100	90	100	100	98	100	100	100	100	100	
オヒシバ	100	100	100	100	100	100	100	100	98	100	
ノボロギク	-	-	-	0	-	-	-	-	0	0	
ギネアキビ	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	
ツノアイアシ	80	75	80	90	75	90	80	85	85	90	
セイバンモロコシ	95	98	98	90	90	95	98	98	60	95	
ホウキギ	-	-	-	0	-	-	-	-	0	-	
ウスベニアオイ	-	0	0	0	0	0	-	-	0	0	40
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	30	35	
アメリカキンゴジカ	-	-	-	0	-	-	-	-	0	0	
ハマスゲ	0	0	0	35	0	0	-	0	75	98	
スベリヒユ	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	
シバムギ	95	65	60	70	50	70	100	90	95	70	
ロシアアザミ	-	-	-	0	-	-	-	-	0	0	

【0383】

【表 104】

ネズミムギ	100	100	100	100	100	100	-	100	90	100
シンクリノイガ	100	90	100	100	100	100	100	100	98	100
メリケンニクキビ	100	80	100	100	100	100	100	100	-	98
ノゲシ	-	-	-	0	-	-	-	-	0	0
マルバツユクサ	0	0	0	-	0	0	0	0	-	-
シグナルグラス	100	95	100	100	100	100	100	100	100	100

表 E

化合物

31 g ai/ha	11	12	19	21	31	33	34	35	36	39	40	43	53
出芽前													
イヌビエ	98	95	100	100	75	100	100	95	95	100	100	100	100
ギョウギシバ	100	95	100	95	95	98	90	98	100	95	98	70	98
クロガラシ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
イチゴツナギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	-	0	0
ハコベ	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	0	-
オニメヒシバ	100	98	100	100	75	100	50	95	98	98	100	70	95
メヒシバの一種	100	100	98	100	98	100	100	100	100	98	100	35	100
シマスズメノヒエ	85	100	95	100	75	80	85	90	75	98	100	80	80
バージニアデイフラワー	0	0	-	-	-	-	0	-	-	-	-	0	0
セイヨウヒルガオ	0	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
エノコログサ	98	100	100	100	60	100	75	90	95	98	98	85	65
オヒシバ	90	75	90	100	100	98	95	100	98	100	100	95	100
ノボロギク	0	0	0	-	-	-	0	-	-	-	-	0	0
ギネアキビ	98	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
ツノアイアシ	80	80	80	75	75	80	85	75	75	75	75	50	85
セイバンモロコシ	95	95	98	90	80	85	90	80	85	80	75	50	90
ホウキギ	0	0	0	-	-	-	0	-	-	-	-	0	0
ウスベニアオイ	-	0	0	-	0	0	0	-	0	-	-	0	-
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20	0
アメリカキンゴジカ	0	0	0	-	-	-	0	-	-	-	-	0	0
ハマスゲ	0	0	-	0	0	0	20	-	0	0	0	0	35
スベリヒユ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
シバムギ	75	80	80	90	20	20	50	40	50	95	80	80	65
ブタクサ	0	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
ロシアアザミ	0	-	0	-	-	-	0	-	-	-	-	0	0
ネズミムギ	100	98	100	100	90	100	100	100	100	100	100	90	100
シンクリノイガ	95	95	95	100	20	90	90	90	100	100	100	75	100
メリケンニクキビ	100	95	80	100	65	98	90	100	100	95	98	100	98
ノゲシ	-	-	-	-	-	-	0	-	-	-	-	0	0

【0384】

10

20

30

40

50

【表 1 0 5】

コバノセンダングサ	0	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-
マルバツユクサ	-	-	-	0	0	0	-	0	0	0	0	-	-
シグナルグラス	95	95	100	100	95	98	100	100	100	100	100	70	100

表 E

化合物

16 g ai/ha	11	19	21	31	33	34	35	36	39	40	43	53	
出芽前													
イヌビエ	90	95	100	15	80	80	80	95	90	95	50	95	10
ギョウギシバ	40	95	90	75	90	40	80	100	75	80	30	80	
クロガラシ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
イチゴツナギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	90	0	0	
ハコベ	-	-	-	-	-	0	-	-	-	-	0	-	
オニメヒシバ	30	95	100	40	75	-	20	95	60	70	0	40	
メヒシバの一種	95	-	95	50	95	100	98	100	98	90	35	80	
シマスズメノヒエ	35	90	100	15	50	50	40	60	98	95	40	65	
バージニアデイフラワー	0	0	-	-	-	0	-	-	-	-	0	0	20
セイヨウヒルガオ	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	
エノコログサ	98	65	100	5	65	65	35	60	90	75	25	20	
オヒシバ	50	70	100	35	98	65	75	98	80	98	65	80	
ノボロギク	0	0	-	-	-	0	-	-	-	-	0	0	
ギネアキビ	98	100	100	90	100	100	100	100	100	100	95	98	
ツノアイアシ	65	65	65	0	60	80	75	65	60	60	35	75	
セイバンモロコシ	90	95	75	25	75	50	75	75	75	75	0	70	
ハウキギ	0	0	-	-	-	0	-	-	-	-	0	0	30
ウスベニアオイ	-	0	-	-	0	0	-	0	-	-	0	-	
マルバルコウソウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
アメリカキンゴジカ	0	0	-	-	-	0	-	-	-	-	0	0	
ハマスゲ	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
スベリヒユ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
シバムギ	60	65	50	0	20	20	20	20	60	60	70	35	
ブタクサ	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	
ロシアアザミ	-	-	-	-	-	0	-	-	-	-	0	0	40
ネズミムギ	80	100	100	65	98	80	98	100	100	98	90	90	
シンクリノイガ	90	80	98	15	90	75	75	90	90	98	60	30	
メリケンニクキビ	90	80	98	15	75	65	80	70	85	95	60	40	
ノゲシ	0	-	-	-	-	0	-	-	-	-	0	0	
コバノセンダングサ	0	0	-	-	-	-	-	-	-	-	-	-	
マルバツユクサ	-	-	0	0	0	-	0	0	0	0	-	-	
シグナルグラス	95	100	100	20	98	98	95	95	100	100	50	100	

【表 106】

表 E

化合物

8 g ai/ha

11 12 19 21 31 33 35 36 39 40

出芽前

イヌビエ

75 70 75 95 0 65 40 80 90 75

ギョウギシバ

25 75 60 40 0 90 60 75 20 40

クロガラシ

0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

イチゴツナギ

0 0 0 0 0 0 0 0 0 60

オニメシバ

0 35 15 65 0 40 20 35 30 50

メシバの一種

40 95 98 - 0 75 75 90 75 90

シマスズメノヒエ

20 40 40 80 0 25 0 35 35 80

バージニアデイフラワー

0 0 0 - - - - - - -

セイヨウヒルガオ

0 0 0 - - - - - - -

エノコログサ

50 60 40 75 0 40 15 15 75 40

オヒシバ

25 65 40 95 20 75 20 30 75 75

ノボロギク

0 0 0 - - - - - - -

ギネアキビ

0 95 75 100 35 100 90 100 100 100

ツノアイアシ

35 35 65 40 0 50 0 15 50 35

セイバンモロコシ

75 90 90 60 15 35 30 60 60 40

ホウキギ

0 0 0 - - - - - - -

ウスベニアオイ

0 0 - - - 0 0 0 0 -

マルバルコウソウ

0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

アメリカキンゴジカ

0 0 0 - - - - - - -

ハマスゲ

- - - 0 - 0 0 0 0 0

スベリヒユ

0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

シバムギ

10 20 30 40 0 0 0 0 50 40

ブタクサ

0 0 0 - - - - - - -

ロシアアザミ

0 - - - - - - - - -

ネズミムギ

80 80 75 100 0 90 75 80 100 90

シンクリノイガ

35 40 60 90 0 50 30 40 90 50

メリケンニクキビ

60 15 80 80 0 75 60 50 80 60

コバノセンダングサ

0 0 0 - - - - - - -

マルバツユクサ

- - - 0 0 0 0 0 0 0

シグナルグラス

70 80 100 98 10 90 75 95 100 98

表 E

化合物

4 g ai/ha

11 12 19

出芽前

イヌビエ

0 20 0

ギョウギシバ

15 35 25

表 E

化合物

4 g ai/ha

11 12 19

出芽前

ホウキギ

0 0 0

ウスベニアオイ

- 0 -

【表 107】

クロガラシ	0	0	0	マルバルコウソウ	0	0	0
イチゴツナギ	0	0	0	アメリカキンゴジカ	0	0	0
オニメヒシバ	0	0	0	ハマスゲ	-	-	0
メヒシバの一種	-	15	35	スベリヒユ	0	0	0
シマスズメノヒエ	10	0	20	シバムギ	0	0	0
バージニアディフラワー	0	0	0	ブタクサ	0	0	0
セイヨウヒルガオ	0	0	0	ロシアアザミ	-	0	-
エノコログサ	0	0	0	ネズミムギ	20	40	65
オヒシバ	25	25	15	シンクリノイガ	0	0	0
ノボロギク	0	0	0	メリケンニクキビ	0	0	40
ギネアキビ	0	0	60	ノゲシ	-	0	-
ツノアイアシ	0	20	10	コバノセンダングサ	0	-	0
セイバンモロコシ	75	75	75	シグナルグラス	0	0	50

10

【0387】

20

テスト F

このテストは、3種の植物種に対する、化合物3、化合物11、または化合物12と、商品作物解毒剤クロキントセットメキシルとの混合物の効果を評価した。冬コムギ (T R Z A W、T r i t i c u m a e s t i v u m)、冬オオムギ (H O R V X、H o r d e u m v u l g a r e)、および野生種のカラスムギ (A V E F A、A v e n a f a t u a) (雑草) からなるテスト植物の種子をローム土壌および砂のブレンド中に植えると共に、界面活性剤を含んでいた非植物毒性溶媒混合物中で配合したテスト化学物質を用いて、直接土壌噴霧で出芽前処理した。同時に、これらの作物および雑草種から選択した植物を、同一の様式で配合したテスト化学物質の出芽後適用で処理した。出芽後処理について、植物の高さは、2 ~ 18 cm (1 ~ 4 葉ステージ) の範囲であった。

30

【0388】

植物を、追加的な照明を用いて約16時間の日長を維持した温室中で成長させ；昼間および夜間温度は、それぞれ、約24 ~ 30 および19 ~ 21 とした。バランスのとれた肥料を灌水システムを介して適用した。処理は、457 L / h a の噴霧体積を用いる、化合物3、化合物11、または化合物12および単独で、かつ、組み合わせでの上述の解毒剤から構成されていた。各処理を3回繰り返した。処理済みの植物および対照を、14 ~ 21日間にわたって温室中に維持した、その後、すべての処理済みの植物を対照と比較して、視覚的に評価した。植物応答評価は3回の反復の平均として算出すると共に、表F1 ~ F6にまとめ、ならびに、これらは、0は効果がなく、かつ、100は完全な防除である0 ~ 100のスケールに基づいている。クロキントセットメキシルは単独では、テストでの使用量で被害を生じさせなかったため、化合物3とクロキントセットメキシルとの混合物の予期した効果は、単独で適用した化合物3の観察された効果と同じである。観察されたおよび予期した相乗効果が、表F1 ~ F6に列挙されている。

40

【0389】

【表 108】

表 F1-化合物 3 単独およびクロキントセットメキシルとの組み合わせからの観察結果および予測結果*

出芽前施用量 (g a.i./ha)		TRZAW		HORVX		AVEFA	
化合物 3	クロキントセット メキシル	Obsd.	Exp.	Obsd.	Exp.	Obsd.	Exp.
4	-	0	-	10	-	0	-
8	-	33	-	32	-	35	-
16	-	77	-	68	-	60	-
-	4	0	-	0	-	0	-
-	8	0	-	0	-	0	-
4	4	0	0	0	10	0	0
4	8	5	0	3	10	0	0
8	4	17	33	20	32	53	35
8	8	33	33	17	32	40	35
16	4	58	77	75	68	67	60
16	8	75	77	65	68	78	60

* 施用量は、ヘクタール当たりの有効成分のグラム数である(g a.i./ha)。「Obsd.」は観察された効果
「Exp.」は予測した効果

【0390】

表 F 1 に列挙した結果から見る事が可能であるとおり、TRZAW に対する観察結果は、6 回の併用処理のうち 3 回で、および、HORVX については、6 回の併用処理のうち 5 回で予想より低く、これにより、化合物 3 およびクロキントセットメキシルのこれらの混合物施用量での薬害軽減が示された。

【0391】

10

20

30

【表 109】

表 F2-化合物 3 単独およびクロキントセットメキシルとの組み合わせからの観察結果および予測結果*

出芽後施用量 (g a.i./ha)		TRZAW		HORVX		AVEFA	
化合物 3	クロキントセットメ キシル	Obsd.	Exp.	Obsd.	Exp.	Obsd.	Exp.
4	-	0	-	0	-	27	-
8	-	0	-	0	-	67	-
16	-	22	-	15	-	83	-
-	4	0	-	0	-	0	-
-	8	0	-	0	-	0	-
4	4	0	0	0	0	30	27
4	8	0	0	0	0	28	27
8	4	0	0	3	0	55	67
8	8	0	0	0	0	67	67
16	4	0	22	0	15	85	83
16	8	5	22	0	15	85	83

* 施用量は、ヘクタール当たりの有効成分のグラム数である(g a.i./ha)
「Obsd.」は観察された効果。「Exp.」は予測した効果

【0392】

表 F 2 に列挙した結果から見る事が可能であるとおり、T R Z A W および H O R V X に対する観察結果は、16 g a i / h a の化合物 3 および 4 で、または、8 g a i / h a のクロキントセットメキシルで予想より低く、これにより、化合物 3 およびクロキントセットメキシルのこれらの混合物施用量での薬害軽減が示された。

【0393】

10

20

30

【表 1 1 0】

表 F3-化合物 11 単独およびクロキントセットメキシルとの組み合わせからの観察結果および予測結果*

出芽前施用量(g a.i./ha)		TRZAW		HORVX		AVEFA	
化合物 11	クロキントセット メキシル	Obsd.	Exp.	Obsd.	Exp.	Obsd.	Exp.
4	-	32	-	22	-	58	-
8	-	72	-	70	-	77	-
16	-	92	-	92	-	93	-
-	4	0	-	0	-	0	-
-	8	0	-	0	-	0	-
4	4	23	32	38	22	73	58
4	8	60	32	63	22	77	58
8	4	73	72	82	70	90	77
8	8	92	72	85	70	92	77
16	4	95	92	93	92	96	93
16	8	98	92	95	92	96	93

* 施用量は、ヘクタール当たりの有効成分のグラム数である(g a.i./ha)
「Obsd.」は観察された効果。「Exp.」は予測した効果

【0 3 9 4】

表 F 3 に列挙した結果から見る事が可能であるとおり、T R Z A W に対する観察結果は、6 回の併用処理のうち 1 回で予想より低く、これにより化合物 1 1 およびクロキントセットメキシルのこの混合物施用量での薬害軽減が示された。

【0 3 9 5】

【表 1 1 1】

表 F4-化合物 11 単独およびクロキントセットメキシルとの組み合わせからの観察結果および予測結果*

出芽後施用量 (g a.i./ha)		TRZAW		HORVX		AVEFA	
化合物 11	クロキントセット メキシル	Obsd.	Exp.	Obsd.	Exp.	Obsd.	Exp.
4	-	18	-	5	-	75	-
8	-	3	-	55	-	97	-
16	-	32	-	90	-	98	-
-	4	0	-	0	-	0	-
-	8	0	-	0	-	0	-
4	4	18	18	3	5	94	75
4	8	0	18	7	5	91	75
8	4	32	3	32	55	96	97
8	8	28	3	18	55	98	97
16	4	98	32	87	90	99	98
16	8	67	32	90	90	100	98

* 施用量は、ヘクタール当たりの有効成分のグラム数である(g a.i./ha)
「Obsd.」は観察された効果。「Exp.」は予測した効果

【0396】

表 F 4 に列挙した結果から見る事が可能であるとおり、HORVX に対する観察結果は、6 回の併用処理のうち 4 回で、ならびに、TRZAW については、4 g a.i./ha の化合物 11、および、8 g a.i./ha のクロキントセットメキシルで予想より低く、これにより、化合物 11 およびクロキントセットメキシルのこれらの混合物施用量での薬害軽減が示された。

【0397】

10

20

30

【表 1 1 2】

表 F5-化合物 12 単独およびクロキントセットメキシルとの組み合わせからの観察結果および予測結果*

出芽前施用量 (g a.i./ha)		TRZAW		HORVX		AVEFA	
化合物 12	クロキントセット メキシル	Obsd.	Exp.	Obsd.	Exp.	Obsd.	Exp.
4	-	0	-	10	-	7	-
8	-	75	-	73	-	92	-
16	-	97	-	80	-	96	-
-	4	0	-	0	-	0	-
-	8	0	-	0	-	0	-
4	4	23	0	35	10	70	7
4	8	30	0	37	10	67	7
8	4	73	75	75	73	85	92
8	8	83	75	80	73	90	92
16	4	93	97	93	80	96	96
16	8	97	97	92	80	93	96

* 施用量は、ヘクタール当たりの有効成分のグラム数である(g a.i./ha)
「Obsd.」は観察された効果。「Exp.」は予測した効果

【0 3 9 8】

表 F 5 に列挙した結果から見る事が可能であるとおり、T R Z A W に対する観察結果は、化合物 1 2 およびクロキントセットメキシルのこれらの混合物施用量で最低限の薬害軽減を示す。

【0 3 9 9】

【表 1 1 3】

表 F6-化合物 12 単独およびクロキントセットメキシルとの組み合わせからの観察結果および予測結果*

出芽後施用量 (g a.i./ha)		TRZAW		HORVX		AVEFA	
化合物 12	クロキントセット メキシル	Obsd.	Exp.	Obsd.	Exp.	Obsd.	Exp.
4	-	0	-	0	-	13	-
8	-	18	-	32	-	98	-
16	-	77	-	65	-	100	-
-	4	0	-	0	-	0	-
-	8	0	-	0	-	0	-
4	4	7	0	0	0	75	13
4	8	0	0	0	0	93	13
8	4	37	18	0	32	98	98
8	8	0	18	3	32	96	98
16	4	47	77	67	65	99	100
16	8	7	77	57	65	99	100

* 施用量は、ヘクタール当たりの有効成分のグラム数である(g a.i./ha)
「Obsd.」は観察された効果。「Exp.」は予測した効果

【0400】

表 F 6 に列挙した結果から見る事が可能であるとおり、TRZAW および HORVX に対する観察結果は、6 回の併用処理のうち 3 回で予想より低く、これにより、化合物 12 およびクロキントセットメキシルのこれらの混合物施用量での薬害軽減が示された。

【0401】

テスト G

このテストは、3 種の植物種に対する化合物 26 と、商品作物解毒剤クロキントセットメキシル、メフェンピル - ジエチル、およびフェンクロラゾール - エチルとの混合物の効果を評価した。冬コムギ (TRZAW、*Triticum aestivum*)、冬オオムギ (HORVX、*Hordeum vulgare*)、および野生種のカラスムギ (AVEFA、*Avena fatua*) (雑草) の種子をシルト質壤土中に植えた。これらの種子からの植物を、界面活性剤を含んでいた非植物毒性溶媒混合物中で配合したテスト化学物質を用いて出芽後処理した。植物の高さは、6 ~ 10 cm (2 ~ 3 葉ステージ) の範囲であった。

【0402】

植物を、追加的な照明を用いて約 14 時間の日長を維持した温室中で成長させ；昼間および夜間温度は、それぞれ、約 22 ~ 26 および 15 ~ 19 とした。バランスのとれた肥料を灌水システムを介して適用した。処理は、281 L / ha の噴霧体積を用いる、化合物 26 および単独で、かつ、組み合わせでの上述の解毒剤から構成されていた。各処理を 4 回繰り返した。処理済みの植物および対照を、15 日間にわたって温室中に維持した、その後、すべての処理済みの植物を対照と比較して、視覚的に評価した。植物応答評価は、0 は効果がなく、および、100 は完全な防除である 0 ~ 100 のスケールに基づいて 4 回の反復の平均として算出し、表 G 1 ~ G 3 にまとめられている。解毒剤は単独では、テストでの使用量で被害を生じさせなかったため、化合物 26 と解毒剤との混合物の予期した効果は、化合物 26 単独での観察された効果と同じである。観察されたおよび予

期した相乗効果が、表 G 1 ~ G 3 に列挙されている。

【 0 4 0 3 】

各解毒剤の最高施用量を単独でテストして、125 g a.i./ha で出芽後に適用した場合のテスト種に対する除草活性の欠如を確認した。従って、16、31、または62 g a.i./ha での各解毒剤単独に対するゼロの推定結果を用いて、化合物 26 およびこれらの解毒剤施用量の混合物応答を算出した。

【 0 4 0 4 】

【 表 1 1 4 】

表 G1-化合物 26 単独およびクロキントセットメキシルとの組み合わせからの観察結果および予測結果*

10

出芽後施用量 (g a.i./ha)		TRZAW		HORVX		AVEFA	
Cmpd 26	クロキントセット メキシル	Obsd.	Exp.	Obsd.	Exp.	Obsd.	Exp.
62	-	10	-	19	-	89	-
125	-	9	-	34	-	97	-
250	-	36	-	45	-	99	-
-	125	0	-	0	-	0	-
62	16	3	10	4	19	97	89
62	31	3	10	15	19	96	89
125	31	8	9	20	34	96	97
125	62	8	9	21	34	99	97
250	62	21	36	25	45	99	99
250	125	18	36	20	45	100	99

20

* 施用量は、ヘクタール当たりの有効成分のグラム数である(g a.i./ha)。「Obsd.」は観察された効果。「Exp.」は予測した効果。Cmpd は化合物を意味する。

30

【 0 4 0 5 】

表 G 1 に列挙した結果から見る事が可能であるとおり、TRZAW および HORVX に対する観察結果は予想より低く、これにより化合物 26 およびクロキントセットメキシルのこれらの混合物適用量での薬害軽減が示された。

【 0 4 0 6 】

【表 1 1 5】

表 G2-化合物 26 単独およびメフェンピル-ジエチルとの組み合わせからの観察結果および予測結果*

出芽後施用量(g a.i./ha)		TRZAW		HORVX		AVEFA	
Cmpd 26	クロキントセット メキシル	Obsd.	Exp.	Obsd.	Exp.	Obsd.	Exp.
62	-	10	-	19	-	89	-
125	-	9	-	34	-	97	-
250	-	36	-	45	-	99	-
-	125	0	-	0	-	0	-
62	16	0	10	8	19	95	89
62	31	0	10	3	19	95	89
125	31	0	9	16	34	100	97
125	62	3	9	14	34	96	97
250	62	14	36	16	45	100	99
250	125	8	36	30	45	99	99

* 施用量は、ヘクタール当たりの有効成分のグラム数である(g a.i./ha)
「Obsd.」は観察された効果。「Exp.」は予測した効果。Cmpd は化合物を意味する

【0 4 0 7】

表 G 2 に列挙した結果から見る事が可能であるとおり、T R Z A W および H O R V X に対する観察結果は予想より低く、これにより化合物 2 6 およびメフェンピル - ジエチルのこれらの混合物適用量での薬害軽減が示された。

【0 4 0 8】

【表 1 1 6】

表 G3-化合物 26 単独およびフェンクロラゾール-エチルとの組み合わせからの観察結果および予測結果*

出芽後施用量 (g a.i./ha)		TRZAW		HORVX		AVEFA	
Cmpd 26	フェンクロラゾール- エチル	Obsd.	Exp.	Obsd.	Exp.	Obsd.	Exp.
62	-	10	-	19	-	89	-
125	-	9	-	34	-	97	-
250	-	36	-	45	-	99	-
-	125	0	-	0	-	0	-
62	16	0	10	5	19	93	89
62	31	0	10	13	19	95	89
125	31	0	9	14	34	96	97
125	62	0	9	20	34	98	97
250	62	19	36	46	45	100	99
250	125	16	36	44	45	99	99

* 施用量は、ヘクタール当たりの有効成分のグラム数である(g a.i./ha)
「Obsd.」は観察された効果。「Exp.」は予測した効果。Cmpd は化合物を意味する

【 0 4 0 9 】

表 G 3 に列挙した結果から見る事が可能であるとおり、T R Z A WおよびH O R V X に対する観察結果は、1 2 回の併用処理のうち1 1 回で予想より低く、これにより化合物 2 6 およびフェンクロラゾール - エチルのこれらの混合物適用量での薬害軽減が示された。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

		International application No PCT/US2008/087577
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D237/16 C07D401/14 C07D403/04 C07D403/10 C07D405/14 C07D409/14 C07D413/04 C07D417/04 C07D417/14 A61K31/501 A01N43/58		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D A61K A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used) EPO-Internal		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2007/119434 A (SUMITOMO CHEMICAL CO [JP]; KIJU TOSHIYUKI [JP]; FUSAKA TAKAFUMI [JP]) 25 October 2007 (2007-10-25) the whole document	1-10
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents : "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art. "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 25 March 2009		Date of mailing of the international search report 02/04/2009
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3018		Authorized officer Diederik, Jeroen

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/US2008/087577

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2007119434 A	25-10-2007	AR 059904 A1	07-05-2008
		AU 2007237660 A1	25-10-2007
		CA 2645272 A1	25-10-2007
		EP 1996557 A1	03-12-2008
		KR 20080105084 A	03-12-2008
<hr/>			

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	テーマコード(参考)
C 0 7 D 403/10	(2006.01)	C 0 7 D 403/10	
C 0 7 D 401/14	(2006.01)	C 0 7 D 401/14	
A 0 1 N 43/58	(2006.01)	A 0 1 N 43/58	B
A 0 1 N 43/78	(2006.01)	A 0 1 N 43/78	B
A 0 1 N 43/653	(2006.01)	A 0 1 N 43/653	C
A 0 1 N 47/06	(2006.01)	A 0 1 N 47/06	D
A 0 1 P 13/00	(2006.01)	A 0 1 P 13/00	

(81)指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), EP(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, T R), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, K G, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW

(72)発明者 エリック・アレン・マーシャル
アメリカ合衆国メリーランド州 2 1 9 2 1 . エルクトン . シマロンサークル 2 3

(72)発明者 アンドルー・イー・タッグ
アメリカ合衆国デラウェア州 1 9 7 1 1 . ニューアーク . トレモントコート 2 1

F ターム(参考) 4C063 AA01 AA03 BB02 BB06 BB08 CC28 CC29 CC42 CC62 CC78
CC95 DD12 DD22 DD25 DD28 EE01
4H011 AB01 BA01 BB09 BB10 BB12 BC03 BC06 BC07 BC18 BC20
DA02 DA15 DA16 DC05 DC06 DD01 DD03 DD04

【要約の続き】

たは組成物を接触させる工程を含む望ましくない植生を防除する方法もまた開示されている。