

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第6905521号
(P6905521)

(45) 発行日 令和3年7月21日(2021.7.21)

(24) 登録日 令和3年6月29日(2021.6.29)

(51) Int.Cl.	F 1
C07D 401/04	(2006.01) C07D 401/04
C07D 405/04	(2006.01) C07D 405/04 C S P
C07D 409/04	(2006.01) C07D 409/04
C07D 417/04	(2006.01) C07D 417/04
C07D 495/04	(2006.01) C07D 495/04 105A

請求項の数 12 (全 127 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2018-522012 (P2018-522012)	(73) 特許権者	391022452 エフ エム シー コーポレーション FMC CORPORATION アメリカ合衆国 19104 ペンシルベニア州 フィラデルフィア ウォールナットストリート2929
(86) (22) 出願日	平成28年10月26日(2016.10.26)	(74) 代理人	100127926 弁理士 結田 純次
(65) 公表番号	特表2018-533577 (P2018-533577A)	(74) 代理人	100140132 弁理士 竹林 則幸
(43) 公表日	平成30年11月15日(2018.11.15)	(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、イロクオイコート103
(86) 國際出願番号	PCT/US2016/058762		
(87) 國際公開番号	W02017/074992		
(87) 國際公開日	平成29年5月4日(2017.5.4)		
審査請求日	令和1年10月25日(2019.10.25)		
(31) 優先権主張番号	62/247,585		
(32) 優先日	平成27年10月28日(2015.10.28)		
(33) 優先権主張国・地域又は機関	米国(US)		

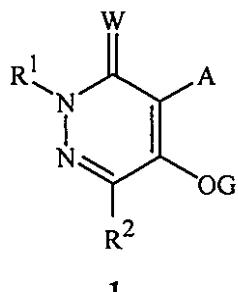
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】新規なピリダジノン除草剤

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式1の化合物、その立体異性体、N-オキシド、および塩
【化1】



10

(式中、

R¹は、H、C₁～C₇アルキル、C₃～C₈アルキルカルボニルアルキル、C₃～C₈アルコキシカルボニルアルキル、C₄～C₇アルキルシクロアルキル、C₃～C₇アルケニル、C₃～C₇アルキニル、C₃～C₇シクロアルキル、C₄～C₇シクロアルキルアルキル、C₂～C₃シアノアルキル、C₁～C₄ニトロアルキル、C₂～C₇ハロアルコキアルキル、C₁～C₇ハロアルキル、C₃～C₇ハロアルケニル、C₂～C₇アル

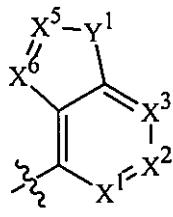
20

コキシアルキル、C₃～C₇アルキルチオアルキル、C₁～C₇アルコキシ、ベンジルもしくはフェニル；または炭素ならびに1個以下のOおよび1個以下のSから選択される環員を含有する5もしくは6員の飽和もしくは部分飽和の複素環式環であり；

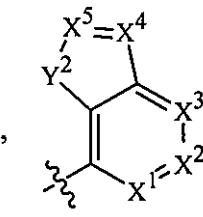
Wは、OまたはSであり；

Aは、

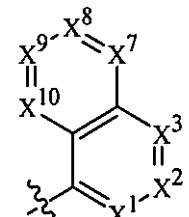
【化2】



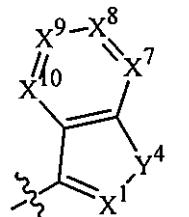
A-1



A-2



および



A-4

10

から選択され；

Gは、G¹またはW¹G¹であり；

W¹は、C₁～C₄アルカンジイルまたはC₂～C₄アルケンジイルであり；

G¹は、H、-C(=O)R⁷、-C(=S)R⁷、-CO₂R⁸、-C(=O)SR⁸²⁰、-S(O)₂R⁷、-CONR⁹R¹⁰、-S(O)₂NR⁹R¹⁰もしくはP(=O)R¹¹；またはC₁～C₄アルキル、C₂～C₄アルケニル、C₂～C₄アルキニル、C₁～C₄ハロアルキル、C₂～C₄ハロアルケニル、C₂～C₄ハロアルキニル、C₁～C₄アルコキシアルキル、C₃～C₆シクロアルキルもしくはC₄～C₇シクロアルキルアルキル；または5もしくは6員複素環式環であり；

R²は、H、ハロゲン、-CN、C₁～C₃アルキル、シクロプロピル、C₁～C₂ハロアルキル、メトキシまたはエトキシであり；

各X¹は、独立してNまたはCR³であり；

各X²は、独立してNまたはCR³であり；

各X³は、独立してNまたはCR³であり；

各X⁴、X⁵およびX⁶は、独立してNまたはCR⁴であり；

各X⁷、X⁸、X⁹およびX¹⁰は、独立してNまたはCR⁵であり；

Y¹は、OまたはSであり；

Y²は、OまたはSであり；

Y⁴は、OまたはSであり；

各R³は、独立してH、ハロゲン、ニトロ、-CN、C₁～C₅アルキル、C₂～C₅アルケニル、C₂～C₅アルキニル、C₃～C₅シクロアルキル、C₄～C₅シクロアルキルアルキル、C₁～C₅ハロアルキル、C₃～C₅ハロアルケニル、C₃～C₅ハロアルキニル、C₂～C₅アルコキシアルキル、C₁～C₅アルコキシ、C₁～C₅ハロアルコキシ、C₁～C₅アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₅ハロアルキルチオまたはC₂～C₅アルコキシカルボニルであり；

各R⁴は、独立してH、ハロゲン、ニトロ、-CN、C₁～C₅アルキル、C₂～C₅アルケニル、C₂～C₅アルキニル、C₃～C₅シクロアルキル、C₄～C₅シクロアルキルアルキル、C₁～C₅ハロアルキル、C₃～C₅ハロアルケニル、C₃～C₅ハロアルキニル、C₂～C₅アルコキシアルキル、C₁～C₅アルコキシ、C₁～C₅ハロアルコキシ、C₁～C₅アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₅ハロアルキルチオまたはC₂～C₅アルコキシカルボニルであり；

各R⁵は、独立してH、ハロゲン、-CN、ニトロ、C₁～C₅アルキル、C₂～C₅

20

30

40

50

アルケニル、C₂～C₅アルキニル、C₃～C₅シクロアルキル、C₄～C₅シクロアルキルアルキル、C₁～C₅ハロアルキル、C₃～C₅ハロアルケニル、C₃～C₅ハロアルキニル、C₂～C₅アルコキシアルキル、C₁～C₅アルコキシ、C₁～C₅ハロアルコキシ、C₁～C₅アルキルチオ、C₁～C₅ハロアルキルチオまたはC₂～C₅アルコキシカルボニルであり；

R⁷は、C₁～C₇アルキル、C₃～C₇アルケニル、C₃～C₇アルキニル、C₃～C₇シクロアルキル、C₁～C₇ハロアルキル、C₃～C₇ハロアルケニル、C₂～C₇アルコキシアルキルもしくはC₄～C₇シクロアルキルアルキル；またはフェニル、ベンジルもしくは5～6員複素環式環であり、各フェニル、ベンジルもしくは複素環式環は、ハロゲン、C₁～C₄アルキルまたはC₁～C₄ハロアルキルによって場合により置換されており； 10

R⁸は、C₁～C₇アルキル、C₃～C₇アルケニル、C₃～C₇アルキニル、C₃～C₇シクロアルキル、C₁～C₇ハロアルキル、C₃～C₇ハロアルケニル、C₂～C₇アルコキシアルキルもしくはC₄～C₇シクロアルキルアルキル；またはフェニル、ベンジルもしくは5～6員複素環式環であり、各フェニル、ベンジルもしくは複素環式環は、ハロゲン、C₁～C₄アルキルまたはC₁～C₄ハロアルキルによって場合により置換されており；

R⁹は、C₁～C₇アルキル、C₃～C₇アルケニル、C₃～C₇アルキニル、C₃～C₇シクロアルキル、C₂～C₇ハロアルキル、C₃～C₇ハロアルケニル、C₂～C₇アルコキシアルキルもしくはC₄～C₇シクロアルキルアルキル；またはフェニル、ベンジルもしくは5～6員複素環式環であり、各フェニル、ベンジルもしくは複素環式環は、ハロゲン、C₁～C₄アルキルまたはC₁～C₄ハロアルキルによって場合により置換されており； 20

R¹⁰は、H、C₁～C₇アルキル、C₂～C₇アルケニル、C₂～C₇アルキニル、C₃～C₇シクロアルキル、C₄～C₇シクロアルキルアルキル、C₁～C₇ハロアルキルまたはC₂～C₇アルコキシアルキルであり；

R¹¹は、C₁～C₇アルキルまたはC₁～C₇アルコキシであり；

ただし、

i) AがA-3であり、X²がCR³である場合、X³はCR³以外であり；

ii) AがA-3であり、X³がCR³である場合、X²はCR³以外であり； 30

iii) AがA-4である場合、X⁷、X⁸、X⁹およびX¹⁰のうちの少なくとも1つはCR⁵以外であり；

iv) R¹がCH₃であり；GがHまたはC(=O)CH₃であり；R²がC1またはBrである場合；A-3は4-キノリニル(5-C1)、5-キノリニル、4-イソキノリニル、5-イソキノリニル、6-イソキノリニルおよび8-イソキノリニル以外である)。

【請求項2】

R¹は、H、C₁～C₇アルキル、C₃～C₈アルキルカルボニルアルキル、C₃～C₈アルコキシカルボニルアルキル、C₄～C₇アルキルシクロアルキル、C₃～C₇アルケニル、C₃～C₇アルキニル、C₃～C₇シクロアルキル、C₄～C₇シクロアルキルアルキル、C₂～C₃シアノアルキル、C₁～C₄ニトロアルキル、C₂～C₇ハロアルコキシアルキル、C₁～C₇ハロアルキル、C₃～C₇ハロアルケニル、C₂～C₇アルコキシアルキル、C₃～C₇アルキルチオアルキル、C₁～C₇アルコキシ、ベンジルまたはフェニルであり； 40

Wは、Oであり；

Aは、A-1、A-2またはA-3であり；

G¹は、H、-C(=O)R⁷、-C(=S)R⁷、-CO₂R⁸、-C(=O)SR⁸、-CONR⁹R¹⁰もしくはP(=O)R¹¹；またはC₁～C₄アルキル、C₂～C₄アルケニル、C₂～C₄アルキニル、C₁～C₄ハロアルキル、C₂～C₄ハロアルケニル、C₂～C₄ハロアルキニル、C₁～C₄アルコキシアルキル、C₃～C₆シクロ 50

アルキルもしくはC₄～C₇シクロアルキルアルキルであり；

W¹は、C₁～C₂アルカンジイルまたはC₂～C₃アルケンジイルであり；

R²は、H、C1、B r、I、-CN、メチルまたはメトキシであり；

各X¹は、独立してCR³であり；

各R³は、独立してH、ハロゲン、C₁～C₃アルキル、C₃～C₄シクロアルキル、C₁～C₃ハロアルキルまたはC₁～C₃アルコキシであり；

各R⁴は、独立してH、ハロゲン、C₁～C₃アルキル、C₃～C₄シクロアルキル、C₁～C₃ハロアルキルまたはC₁～C₃アルコキシであり；

各R⁵は、独立してH、ハロゲン、C₁～C₃アルキル、C₃～C₄シクロアルキル、C₁～C₃ハロアルキルまたはC₁～C₃アルコキシであり；

R⁷は、C₁～C₇アルキル、C₃～C₇シクロアルキル、C₁～C₃ハロアルキルまたはC₂～C₇アルコキシアルキルであり；

R⁸は、C₁～C₇アルキル、C₃～C₇シクロアルキル、C₁～C₃ハロアルキルまたはC₂～C₇アルコキシアルキルであり；

R⁹は、C₁～C₇アルキル、C₃～C₇シクロアルキル、C₂～C₃ハロアルキルまたはC₂～C₇アルコキシアルキルであり；

R¹⁰は、H、C₁～C₇アルキル、C₃～C₇シクロアルキル、C₁～C₃ハロアルキルまたはC₂～C₇アルコキシアルキルであり；

R¹¹は、C₁～C₃アルキルまたはC₁～C₃アルコキシである、

請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R¹は、H、C₁～C₇アルキル、C₃～C₈アルコキシカルボニルアルキル、C₄～C₇アルキルシクロアルキル、C₃～C₇シクロアルキル、C₄～C₇シクロアルキルアルキル、C₂～C₃シアノアルキル、C₁～C₄ニトロアルキル、C₂～C₇ハロアルコキシアルキル、C₁～C₇ハロアルキル、C₂～C₇アルコキシアルキル、C₃～C₇アルキルチオアルキル、C₁～C₇アルコキシまたはベンジルであり；

Aは、A-1またはA-2であり；

G¹は、H、-C(=O)R⁷、-CO₂R⁸、-CONR⁹R¹⁰もしくはP(=O)R¹¹；またはC₁～C₄アルキル、C₂～C₄アルケニル、C₁～C₄ハロアルキル、C₂～C₄ハロアルケニル、C₁～C₄アルコキシアルキル、C₃～C₆シクロアルキルもしくはC₄～C₇シクロアルキルアルキルであり；

W¹は、-CH₂-または-CH=CH-であり；

R²は、H、C1、メチルまたはメトキシであり；

各X²は、独立してCR³であり；

各X⁵は、独立してCR⁴であり；

Y¹は、Oであり；

Y²は、Oであり；

各R³は、独立してH、ハロゲン、C₁～C₂アルキル、シクロプロピルまたはC₁～C₂ハロアルキルであり；

各R⁴は、独立してH、ハロゲン、C₁～C₂アルキル、シクロプロピルまたはC₁～C₂ハロアルキルであり；

R⁷は、C₁～C₇アルキル、C₃～C₇シクロアルキルまたはC₂～C₇アルコキシアルキルであり；

R⁸は、C₁～C₇アルキル、C₃～C₇シクロアルキルまたはC₂～C₇アルコキシアルキルであり；

R⁹は、C₁～C₇アルキル、C₃～C₇シクロアルキルまたはC₂～C₇アルコキシアルキルであり；

R¹⁰は、H、C₁～C₇アルキル、C₃～C₇シクロアルキルまたはC₂～C₇アルコキシアルキルであり；

R¹¹は、CH₃またはOCH₃である、

10

20

30

40

50

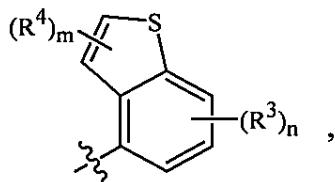
請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

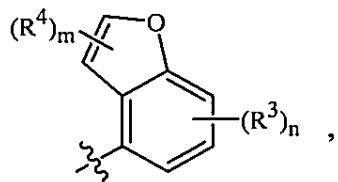
R¹ は、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₄ シクロアルキル、C₂ ~ C₃ シアノアルキル
、C₁ ~ C₃ ハロアルキルまたはC₂ ~ C₄ アルコキシアルキルであり；

A は、

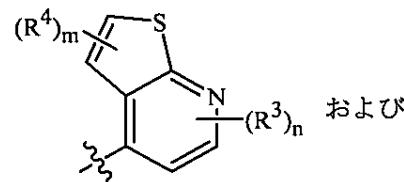
【化 3】



A-1-A

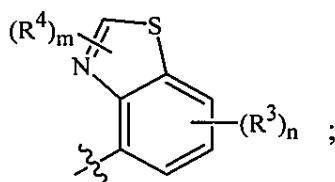


A-1-B



A-1-C

10



A-1-D

20

から選択され；

G¹ は、H、-C(=O)R⁷、-CO₂R⁸ もしくはP(=O)R^{1~1}；またはC₁
~ C₄ アルキル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、C₁ ~ C₄ アルコキシアルキルもしくはC₃
~ C₆ シクロアルキルであり；

W¹ は、-CH₂-であり；

R² は、C₁ またはメチルであり；

各R³ は、独立してH、ハロゲン、メチル、エチルまたはCF₃ であり；

各R⁴ は、独立してH、ハロゲン、メチル、エチルまたはCF₃ であり；

30

R⁷ は、C₁ ~ C₇ アルキルまたはC₂ ~ C₇ アルコキシアルキルであり；

R⁸ は、C₁ ~ C₇ アルキルまたはC₂ ~ C₇ アルコキシアルキルであり；

R^{1~1} は、OCH₃ である、

請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

R¹ は、メチル、エチル、n-プロピルまたは2-メトキシエチルであり；

A は、A-1-A およびA-1-B から選択され；

G は、G¹ であり；

G¹ は、H、-C(=O)R⁷、-CO₂R⁸；またはC₁ ~ C₄ アルコキシアルキル
もしくはC₃ ~ C₆ シクロアルキルであり；

40

各R³ は、独立してH、F、Cl、Br またはメチルであり；

各R⁴ は、独立してH、メチルまたはエチルであり；

R⁷ は、C₁ ~ C₃ アルキルまたはC₂ ~ C₄ アルコキシアルキルであり；

R⁸ は、C₁ ~ C₃ アルキルまたはC₂ ~ C₄ アルコキシアルキルである、

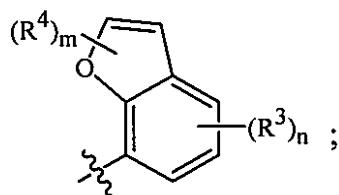
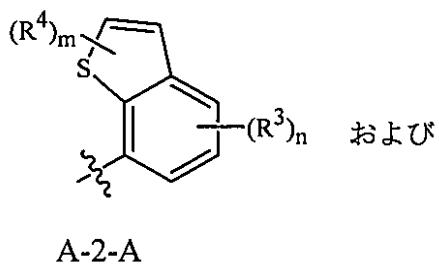
請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

R¹ は、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₄ シクロアルキル、C₂ ~ C₃ シアノアルキル
、C₁ ~ C₃ ハロアルキルまたはC₂ ~ C₄ アルコキシアルキルであり；

A は、

【化4】



10

から選択され；

G^1 は、H、-C(=O)R⁷、-CO₂R⁸ もしくはP(=O)R^{1~1}；またはC₁~C₄アルキル、C₁~C₄ハロアルキル、C₁~C₄アルコキシアルキルもしくはC₃~C₆シクロアルキルであり；

W^1 は、-CH₂-であり；

R^2 は、C1またはメチルであり；

各 R^3 は、独立してH、ハロゲン、メチル、エチルまたはCF₃であり；

各 R^4 は、独立してH、ハロゲン、メチル、エチルまたはCF₃であり；

R^7 は、C₁~C₇アルキルまたはC₂~C₇アルコキシアルキルであり；

R^8 は、C₁~C₇アルキルまたはC₂~C₇アルコキシアルキルであり；

$R^{1~1}$ は、OCH₃である、

請求項3に記載の化合物。

【請求項7】

R^1 は、メチル、エチル、n-プロピルまたは2-メトキシエチルであり；

A は、A-2-Aであり；

G は、G¹であり；

G^1 は、H、-C(=O)R⁷、-CO₂R⁸；またはC₁~C₄アルコキシアルキルもしくはC₃~C₆シクロアルキルであり；

各 R^3 は、独立してH、F、Cl、Brまたはメチルであり；

各 R^4 は、独立してH、メチルまたはエチルであり；

R^7 は、C₁~C₃アルキルまたはC₂~C₄アルコキシアルキルであり；

R^8 は、C₁~C₃アルキルまたはC₂~C₄アルコキシアルキルである、

請求項6に記載の化合物。

【請求項8】

4-(2,6-ジメチル-7-ベンゾフラニル)-5-ヒドロキシ-2,6-ジメチル-3(2H)-ピリダジノン；

5-(アセチルオキシ)-4-(2,6-ジメチル-7-ベンゾフラニル)-2,6-ジメチル-3(2H)-ピリダジノン；

5-ヒドロキシ-2,6-ジメチル-4-(3-メチル-1,2-ベンゾイソチアゾール-4-イル)-3(2H)-ピリダジノン；

5-ヒドロキシ-2,6-ジメチル-4-(5-メチルベンゾ[b]チエン-4-イル)-3(2H)-ピリダジノン；および

1,6-ジヒドロ-1,3-ジメチル-5-(5-メチルベンゾ[b]チエン-4-イル)-6-オキソ-4-ピリダジニルエチルカルボナート

からなる群から選択される、請求項6に記載の化合物。

【請求項9】

請求項1~8のいずれか1項に記載の化合物と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の成分とを含む除草用組成物。

【請求項10】

請求項1~8のいずれか1項に記載の化合物と、他の除草剤および除草剤薬害軽減剤か

20

30

40

50

らなる群から選択される少なくとも1種の追加の有効成分と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の成分とを含む除草用組成物。

【請求項11】

(a) 請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物と、(b)(b1)光化学系II阻害剤、(b2)アセトヒドロキシ酸シンターゼ(AHAS)阻害剤、(b3)アセチル-CoAカルボキシラーゼ(ACCase)阻害剤、(b4)オーキシン模倣体、(b5)5-エノール-ピルビルシキミ酸-3-リン酸(EPSp)シンターゼ阻害剤、(b6)光化学系I電子ダイバータ、(b7)プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼ(PPO)阻害剤、(b8)グルタミンシンセターゼ(GS)阻害剤、(b9)超長鎖脂肪酸(VLCFA)エロンガーゼ阻害剤、(b10)オーキシン輸送阻害剤、(b11)フィトエンデサチュラーゼ(PDS)阻害剤、(b12)4-ヒドロキシフェニルビルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)阻害剤、(b13)ホモゲンチジン酸ソラネシルトランスフェラーゼ(HST)阻害剤、(b14)セルロース生合成阻害剤、(b15)有糸分裂攪乱物質、有機ヒ素剤、アシュラム、ブロモブチド、シンメシリソ、クミルロン、ダゾメット、ジフェンゾコート、ダイムロン、エトベンザニド、フルレノール、ホサミン、ホサミン-アンモニウム、ヒダントシン、メタム、メチルダイムロン、オレイン酸、オキサジクロメフォン、ペラルゴン酸およびピリブチカルブを含む他の除草剤、および(b16)除草剤薬害軽減剤；ならびに(b1)～(b16)の化合物の塩から選択される少なくとも1種の追加の有効成分とを含む除草用混合物。10

【請求項12】

望ましくない植生の成長を防除する方法であって、植生またはその環境に請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物の除草有効量を接触させることを含む、前記方法。20

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、特定のピリダジノン除草剤、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の防除の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、高い農作物生産効率を達成する上で極めて重要である。とりわけイネ、ダイズ、サトウダイコン、トウモロコシ、ジャガイモ、コムギ、オオムギ、トマト、およびプランテーション農作物のような有用な農作物において雑草の成長の選択的防除を達成することは、殊に望ましい。このような有用な農作物において雑草の成長を放置すると、生産性の大幅な低下をもたらす可能性があり、消費者へのコスト増加という結果を招く可能性がある。非農耕地における望ましくない植生の防除も同様に重要である。この目的のために多くの製品が市販されているが、より効果的で、より安価で、より毒性が低く、より環境に安全であり、または作用部位が異なる新しい化合物に対する必要性は、依然として存在する。30

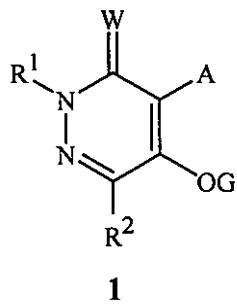
【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0003】

本発明は、式1の化合物とその全ての立体異性体、N-オキシド、および塩、それらを含有する農業用組成物、ならびにそれらの除草剤としての使用に関する40

【化1】



10

(式中、

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_7$ ハロアルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルキルチオアルキル、 $C_1 \sim C_7$ アルコキシ、ベンジルもしくはフェニル；または炭素ならびに1個以下のOおよび1個以下のSから選択される環員を含有する5もしくは6員の飽和もしくは部分飽和の複素環式環であり；

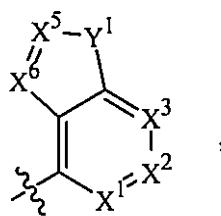
Wは、OまたはSであり；

20

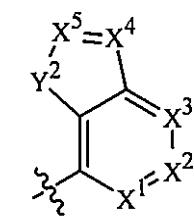
【0004】

Aは、

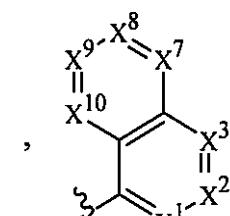
【化2】



A-1

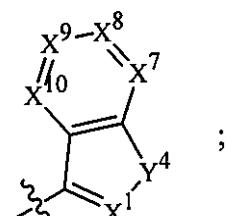


A-2



A-3

および



A-4

30

から選択され；

Gは、 G^1 または $W^1 G^1$ であり； W^1 は、 $C_1 \sim C_4$ アルカンジイルまたは $C_2 \sim C_4$ アルケンジイルであり；

G^1 は、H、-C(=O)R⁷、-C(=S)R⁷、-CO₂R⁸、-C(=O)SR⁸、-S(O)₂R⁷、-CONR⁹R¹⁰、-S(O)₂NR⁹R¹⁰もしくはP(=O)R¹¹；または $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルもしくは $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル；または5もしくは6員複素環式環であり；

R^2 は、H、ハロゲン、-CN、-CHO、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_7$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_7$ ハロアルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$ アル

40

50

コキシ、C₁～C₅アルキルチオもしくはC₂～C₃アルコキシカルボニル；またはハロゲン、C₁～C₄アルキルもしくはC₁～C₄ハロアルキルによって場合により置換されているフェニルであり；

各X¹は、独立してNまたはCR³であり；

各X²は、独立してNまたはCR³であり；

各X³は、独立してNまたはCR³であり；

各X⁴、X⁵およびX⁶は、独立してNまたはCR⁴であり；

各X⁷、X⁸、X⁹およびX¹⁰は、独立してNまたはCR⁵であり；

Y¹は、O、SまたはNR⁶であり；

Y²は、O、SまたはNR⁶であり；

Y⁴は、O、SまたはNR⁶であり；

各R³は、独立してH、ハロゲン、ニトロ、-CN、C₁～C₅アルキル、C₂～C₅アルケニル、C₂～C₅アルキニル、C₃～C₅シクロアルキル、C₄～C₅シクロアルキルアルキル、C₁～C₅ハロアルキル、C₃～C₅ハロアルケニル、C₃～C₅ハロアルキニル、C₂～C₅アルコキシアルキル、C₁～C₅アルコキシ、C₁～C₅ハロアルコキシ、C₁～C₅アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₅ハロアルキルチオまたはC₂～C₅アルコキシカルボニルであり；

各R⁴は、独立してH、ハロゲン、ニトロ、-CN、C₁～C₅アルキル、C₂～C₅アルケニル、C₂～C₅アルキニル、C₃～C₅シクロアルキル、C₄～C₅シクロアルキルアルキル、C₁～C₅ハロアルキル、C₃～C₅ハロアルケニル、C₃～C₅ハロアルキニル、C₂～C₅アルコキシアルキル、C₁～C₅アルコキシ、C₁～C₅ハロアルコキシ、C₁～C₅アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₅ハロアルキルチオまたはC₂～C₅アルコキシカルボニルであり；

各R⁵は、独立してH、ハロゲン、-CN、ニトロ、C₁～C₅アルキル、C₂～C₅アルケニル、C₂～C₅アルキニル、C₃～C₅シクロアルキル、C₄～C₅シクロアルキルアルキル、C₁～C₅ハロアルキル、C₃～C₅ハロアルケニル、C₃～C₅ハロアルキニル、C₂～C₅アルコキシアルキル、C₁～C₅アルコキシ、C₁～C₅ハロアルコキシ、C₁～C₅アルキルチオ、C₁～C₅ハロアルキルチオまたはC₂～C₅アルコキシカルボニルであり；

R⁶は、H、C₁～C₇アルキル、C₂～C₇アルケニル、C₂～C₇アルキニル、C₃～C₇シクロアルキル、C₄～C₇シクロアルキルアルキル、C₁～C₇ハロアルキルまたはC₂～C₇アルコキシアルキルであり；

R⁷は、C₁～C₇アルキル、C₃～C₇アルケニル、C₃～C₇アルキニル、C₃～C₇シクロアルキル、C₁～C₇ハロアルキル、C₃～C₇ハロアルケニル、C₂～C₇アルコキシアルキル、C₄～C₇シクロアルキルアルキル；またはフェニル、ベンジルもしくは5～6員複素環式環であり、各フェニル、ベンジルもしくは複素環式環は、ハロゲン、C₁～C₄アルキルまたはC₁～C₄ハロアルキルによって場合により置換されており；

R⁸は、C₁～C₇アルキル、C₃～C₇アルケニル、C₃～C₇アルキニル、C₃～C₇シクロアルキル、C₁～C₇ハロアルキル、C₃～C₇ハロアルケニル、C₂～C₇アルコキシアルキル、C₄～C₇シクロアルキルアルキル；またはフェニル、ベンジルもしくは5～6員複素環式環であり、各フェニル、ベンジルもしくは複素環式環は、ハロゲン、C₁～C₄アルキルまたはC₁～C₄ハロアルキルによって場合により置換されており；

R⁹は、C₁～C₇アルキル、C₃～C₇アルケニル、C₃～C₇アルキニル、C₃～C₇シクロアルキル、C₂～C₇ハロアルキル、C₃～C₇ハロアルケニル、C₂～C₇アルコキシアルキル、C₄～C₇シクロアルキルアルキル；またはフェニル、ベンジルもしくは5～6員複素環式環であり、各フェニル、ベンジルもしくは複素環式環は、ハロゲン、C₁～C₄アルキルまたはC₁～C₄ハロアルキルによって場合により置換されており；

10

20

30

40

50

ン、C₁～C₄アルキルまたはC₁～C₄ハロアルキルによって場合により置換されており；

R¹⁰は、H、C₁～C₇アルキル、C₂～C₇アルケニル、C₂～C₇アルキニル、C₃～C₇シクロアルキル、C₄～C₇シクロアルキルアルキル、C₁～C₇ハロアルキルまたはC₂～C₇アルコキシアルキルであり；

R¹¹は、C₁～C₇アルキルまたはC₁～C₇アルコキシであり；

ただし、

i) AがA-3であり、X²がCR³である場合、X³はCR³以外であり；

ii) AがA-3であり、X³がCR³である場合、X²はCR³以外であり；

iii) AがA-4であり、Y⁴がO、SまたはNR⁶である場合、X⁷、X⁸、X⁹ 10 およびX¹⁰のうちの少なくとも1つはCR⁵以外であり；

iv) R¹がCH₃であり；GがHまたはC(=O)CH₃であり；R²がC₁またはBrである場合；A-3は4-キノリニル(5-C₁)、5-キノリニル、4-イソキノリニル、5-イソキノリニル、6-イソキノリニルおよび8-イソキノリニル以外である)。

【0005】

より詳細には、本発明は、式1の化合物(全ての立体異性体を含む)、そのN-オキシドまたは塩に関する。本発明は更に、本発明の化合物(即ち、除草有効量の)と、界面活性剤、固体希釈剤、および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の成分とを含む除草用組成物に関する。本発明は更に、植生またはその環境に本発明の化合物(例えば、本明細書に記載する組成物としての)の除草有効量を接触させることを含む、望ましくない植生の成長を防除する方法に関する。 20

【0006】

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

【発明を実施するための形態】

【0007】

本明細書において使用する場合、「含む(comprises)」、「含む(comprising)」、「含む(includes)」、「含む(including)」、「有する(has)」、「有する(having)」、「含有する(contains)」、「含有する(containing)」、「特徴とする(characterized by)」という用語またはそれらの任意の他の変形は、明示的に示された制限に従つて非排他的な包摂を包含することを意図している。例えば、列挙した要素を含む組成物、混合物、プロセスまたは方法は、必ずしもそれらの要素に限定されるものではなく、明確に列挙されていない他の要素、またはそうした組成物、混合物、プロセスもしくは方法に特有な他の要素を含んでもよい。 30

【0008】

「からなる(consisting of)」という移行句は、指定されていない要素、工程、または原材料を除外する。請求項の中にある場合、こうした移行句は、請求項が、通常それに付随する不純物を除く、記載されたもの以外の材料を包含しないことを意味する。「からなる」という句が、プリアンブルの直後ではなく、請求項の本文の分節に出てきた場合、その分節に記載された要素のみを限定し、他の要素は、全体としてその請求項から除外されない。 40

【0009】

「本質的に～からなる(consisting essentially of)」という移行句は、文字通り開示されたものに追加の材料、工程、特徴物、成分、または要素を含む組成物または方法を定義するために使用される。ただし、これら追加の材料、工程、特徴物、成分、または要素は、特許請求される発明の基本的な特性および新規な特性に実質的に影響を及ぼさない。「本質的に～からなる」という用語は、「含む(compr 50

is sing)」と「からなる (consisting of)」の中間の地位を占める。

【0010】

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

【0011】

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

【0012】

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

【0013】

本明細書において言及している場合、単独で、または単語の組合せにおいて使用される「実生」という用語は、種子の胚から成長している若い植物を意味する。

【0014】

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

【0015】

本明細書において使用する場合、「アルキル化」という用語は、求核試薬が炭素含有ラジカルからハライドまたはスルホナートのような脱離基を置き換える反応を指す。別段の指示がない限り、「アルキル化」という用語は、炭素含有ラジカルをアルキルに限定しない。

【0016】

上記の記述において、単独で、または「アルキルチオ」もしくは「ハロアルキル」のような複合語において使用される「アルキル」という用語は、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、または異なるブチル、ペンチルもしくはヘキシル異性体のような、直鎖または分枝アルキルを含む。「アルケニル」は、エテニル、1 - プロペニル、2 - プロペニル、ならびに異なるブテニル、ペンテニルおよびヘキセニル異性体のような、直鎖または分枝アルケンを含む。「アルケニル」は、1 , 2 - ブロパジエニルおよび2 , 4 - ヘキサジエニルのようなポリエンを更に含む。「アルキニル」は、エチニル、1 - プロピニル、2 - プロピニル、ならびに異なるブチニル、ペンチニルおよびヘキシニル異性体のような、直鎖または分枝アルキンを含む。「アルキニル」は、2 , 5 - ヘキサジイニルのような複数の三重結合で構成される部分を更に含むことができる。

【0017】

「アルコキシ」は、例えば、メトキシ、エトキシ、n - プロピルオキシ、イソプロピルオキシ、ならびに異なるブトキシ、ペントキシおよびヘキシルオキシ異性体を含む。「アルコキシアルキル」は、アルキル上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 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 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、アルコキシ上のアルコキシ置換を表す。「アルキルチオ」は、メチルチオ、エチルチオ、ならびに様々なプロピルチオ、ブチルチオ、ペンチルチオおよびヘキシルチオ異性体のような分枝または直鎖アルキルチオ部分を含む。「アルキルチオア

10

20

30

40

50

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。「シアノアルキル」は、1つのシアノ基で置換されたアルキル基を表す。「シアノアルキル」の例としては、 NCCH_2 および NCCH_2CH_2 (代替的に $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$ と表される)が挙げられる。

【0018】

「シクロアルキル」は、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルを含む。「シクロアルキルアルキル」の例としては、シクロプロピルメチル、シクロペンチルエチル、および直鎖または分枝アルキル基に結合した他のシクロアルキル部分が挙げられる。10

【0019】

「ハロゲン」という用語は、単独で、もしくは「ハロアルキル」のような複合語において、または「ハロゲンで置換されているアルキル」のような記載において使用される場合、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を含む。更に、「ハロアルキル」のような複合語において使用される場合、または「ハロゲンで置換されているアルキル」のような記載において使用される場合、前記アルキルは、同一であっても異なっていてもよいハロゲン原子で部分的にまたは完全に置換されていてもよい。「ハロアルキル」または「ハロゲンで置換されているアルキル」の例としては、 F_3C 、 ClCH_2 、 CF_3CH_2 および CF_3CCH_2 が挙げられる。「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」などの用語は、「ハロアルキル」という用語と同様に定義される。20
 「ハロアルコキシ」の例としては、 $\text{CF}_3\text{O}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $\text{HC}\text{F}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ および $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}-$ が挙げられる。「ハロアルキルチオ」の例としては、 $\text{CCl}_3\text{S}-$ 、 $\text{CF}_3\text{S}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}-$ および $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ が挙げられる。「ハロアルケニル」の例としては、 $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2-$ および $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$ が挙げられる。「ハロアルキニル」の例としては、 $\text{HC}\text{Cl}-$ 、 $\text{CF}_3\text{C}\text{C}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{C}\text{C}-$ および $\text{FC}\text{H}_2\text{C}\text{CCH}_2-$ が挙げられる。
 。

【0020】

「アルコキシカルボニル」は、 $\text{C}(=\text{O})$ 部分に結合した直鎖または分枝アルコキシ部分を表す。「アルコキシカルボニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})-$ および様々なブトキシまたはペントキシカルボニル異性体が挙げられる。アルカンジイルまたはアルケンジイルという用語はそれぞれ、直鎖または分枝のアルカンまたはアルケン結合鎖を指す。アルカンジイルの例としては、 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)-$ または $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ が挙げられる。アルケンジイルの例としては、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}=\text{CH}-$ または $-\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)-$ が挙げられる。置換基の位置を示す文脈における「隣接」という用語は、「～の隣」または「～のすぐ隣」という意味である。30

【0021】

置換基中の炭素原子の総数は、「 $\text{C}_i \sim \text{C}_j$ 」という接頭辞によって示され、ここで、 i および j は、1～7の数である。例えば、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルスルホニルは、メチルスルホニル～ブチルスルホニルを指定し； C_2 アルコキシアルキルは、 CH_3OCH_2- を指定し； C_3 アルコキシアルキルは、例えば、 $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)-$ 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ または $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ を指定し； C_4 アルコキシアルキルは、全部で4個の炭素原子を含有するアルコキシ基で置換されているアルキル基の様々な異性体を指定し、例としては、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ が挙げられる。40

【0022】

置換基の数が1を超えることがあることを示す下付き文字を伴う置換基で化合物が置換

されている場合、前記置換基は（1を超える場合）、定義された置換基の群、（例えば、 $(R^3)_n$ の n が 1、2、3 または 4 である場合）から独立して選択される。基が、水素である可能性がある置換基、例えば R^2 または R^4 を含有し、この置換基が水素であると考えられる場合、これは、前記基が無置換であることと同義であると認識される。可変基が場合によりある位置に結合していると示されている場合（例えば、 $(R^3)_n$ の n が 0 であり得る場合）、可変基の定義に記載されていなくても、水素がその位置にあってもよい。ある基上の 1 つまたはそれ以上の位置が「置換されていない」または「非置換」と記載される場合、水素原子が結合して任意の自由原子価を取る。

【0023】

G が H である（即ち、式 1 の「OG」置換基がヒドロキシ部分である）式 1 の化合物は 10 、植物酵素または受容体上の活性部位に結合して植物に除草効果をもたらす化合物であると考えられる。置換基 G が植物または環境中でヒドロキシ部分に変換され得る基である式 1 の他の化合物は、同様の除草効果をもたらし、本発明の範囲に含まれる。従って、G は 、式 1 の化合物の除草活性を消失させず、植物または土壤中で加水分解、酸化、還元、または他の方法で代謝されて、pH 次第で解離した形態または解離していない形態にあるカルボン酸官能基を提供する、または提供する可能性がある当技術分野で公知の任意の誘導体とすることができる。「環系」という用語は、2 つ以上の縮合環を表す。「二環式環系」という用語は、2 つの縮合環からなる環系を表す。

【0024】

本発明の化合物は、1 つまたはそれ以上の立体異性体として存在することができる。様々な立体異性体は、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロブ異性体および幾何異性体を含む。立体異性体は、構成が同一であるが、空間における原子の配置が異なる異性体であり、エナンチオマー、ジアステレオマー、シス - トランス異性体（幾何異性体としても公知である）およびアトロブ異性体を含む。アトロブ異性体は、異性体種の単離が可能であるほど回転障壁が十分に大きい単結合周囲の束縛回転によって生じる。当業者であれば理解することであるが、1 種の立体異性体が他の立体異性体（複数可）と比して豊富化された場合、または他の立体異性体（複数可）から分離された場合、活性が高まる、および / または有益な効果を発揮することがある。更に、当業者には、前記立体異性体を分離、豊富化、および / または選択的に製造する方法は公知である。本発明の化合物は、立体異性体の混合物、個別の立体異性体、または光学的に活性な形態として存在してもよい。 30

【0025】

式 1 の化合物は、典型的には 2 種以上の形態で存在し、従って、式 1 は、それが表す化合物の結晶形態および非結晶形態全てを含む。非結晶形態は、ワックスおよびゴムのような固体である実施形態、ならびに溶液および溶融物のような液体である実施形態を含む。結晶形態は、本質的に単結晶型を表す実施形態、および、多形体（即ち、異なる結晶型）の混合物を表す実施形態を含む。「多形体」という用語は、異なる結晶形態で結晶化が可能である化合物の特定の結晶形態を指し、これらの形態は、結晶格子中に分子の異なる配置および / または配座を有する。多形体は同一の化学組成を有する場合があるが、これらは、格子中に弱くまたは強く結合可能な共結晶化水または他の分子の存在または不在により、組成が異なっている場合もある。多形体は、結晶形状、密度、硬度、色、化学的安定性、融点、吸湿性、懸濁性、溶解速度および生物学的利用可能性のような化学的、物理的および生物学的性質が異なっている場合がある。当業者であれば理解することであるが、式 1 の化合物の多形体は、式 1 の同一の化合物の他の多形体または多形体の混合物に比して、有益な効果（例えば、有用な製剤の製造に対する適合性、生物学的性能の向上）を示す可能性がある。式 1 の化合物の特定の多形体の製造および単離は、例えば、選択した溶媒および温度を用いる結晶化を含む、当業者に公知の方法により達成可能である。多形性に係る包括的な考察については、R. Hillefiker, Ed., polymorphism in the Pharmaceutical Industry, Wiley-VCH, Weinheim, 2006 を参照されたい。 40

【0026】

10

20

30

40

50

当業者であれば理解することであるが、窒素は、酸化物への酸化のためには利用可能な孤立電子対を必要とするため、全ての窒素含有複素環がN-オキシドを形成可能ではない；当業者であれば、N-オキシドを形成可能な窒素含有複素環を認識する。更に、当業者であれば理解することであるが、第三級アミンはN-オキシドを形成可能である。複素環および第三級アミンのN-オキシド製造のための合成方法は当業者に周知であり、過酢酸およびm-クロロ過安息香酸(MCPBA)のようなペルオキシ酸、過酸化水素、t-ブチルヒドロペルオキシドのようなアルキルヒドロペルオキシド、過ホウ酸ナトリウム、ならびにジメチルジオキシランのようなジオキシランによる複素環および第三級アミンの酸化が含まれる。N-オキシドの製造のためのこれらの方法は、文献において広範に記載および概説されており、例えば：T. L. GilchristのComprehensive Organic Synthesis、第7巻、748～750頁、S. V. Ley編、Pergamon Press；M. TislerおよびB. StanovnikのComprehensive Heterocyclic Chemistry、第3巻、18～20頁、A. J. BoultonおよびA. McKillop編、Pergamon Press；M. R. GrimmettおよびB. R. T. KeeneのAdvances in Heterocyclic Chemistry、第43巻、149～161頁、A. R. Katritzky編、Academic Press；M. TislerおよびB. StanovnikのAdvances in Heterocyclic Chemistry、第9巻、285～291頁、A. R. KatritzkyおよびA. J. Boulton編、Academic Press；ならびにG. W. H. CheesemanおよびE. S. G. WerstiukのAdvances in Heterocyclic Chemistry、第22巻、390～392頁、A. R. KatritzkyおよびA. J. Boulton編、Academic Pressを参照されたい。
10

【0027】

当業者であれば認識することであるが、環境中、および生理学的条件下では、化合物の塩はその対応する非塩形態と平衡状態にあるので、塩が非塩形態の生物学的有用性を共有する。従って、式1の化合物の多種多様な塩が、望ましくない植生の防除に有用である（即ち、農学的に適切である）。式1の化合物の塩としては、臭化水素酸、塩酸、硝酸、リン酸、硫酸、酢酸、酪酸、フマル酸、乳酸、マレイン酸、マロン酸、シュウ酸、プロピオン酸、サリチル酸、酒石酸、4-トルエンスルホン酸または吉草酸のような無機酸または有機酸との酸付加塩が挙げられる。式1の化合物がエノール官能基（例えば、GがHである場合）のような酸性部分を含有する場合、塩には、ピリジン、トリエチルアミンもしくはアンモニアのような有機塩基もしくは無機塩基と共に形成された塩、またはナトリウム、カリウム、リチウム、カルシウム、マグネシウムもしくはバリウムのアミド、水素化物、水酸化物または炭酸塩も含まれる。従って、本発明は、式1から選択される化合物、そのN-オキシドおよび農業的に適切な塩を含む。
20

【0028】

R⁷、R⁸またはR⁹が5または6員窒素含有複素環式環である場合、他様の記載がない限り、任意の利用可能な炭素または窒素環原子を介して式1の残部に結合していくよい。上記のように、R⁷、R⁸またはR⁹は、（とりわけ）発明の概要において定義した置換基の群から選択される1つまたはそれ以上の置換基で場合により置換されているフェニルとすることができます。1～5個の置換基で場合により置換されているフェニルの例は、提示1にU-1として図示する環であり、ここで、R^vは、発明の概要においてR⁷、R⁸またはR⁹上の置換基として定義したものであり、rは整数である。
30

【0029】

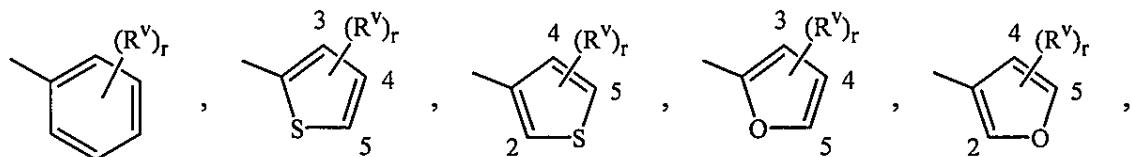
上記のように、R⁷、R⁸またはR⁹は、（とりわけ）飽和または不飽和であってもよく、発明の概要において定義した置換基の群から選択される1つまたはそれ以上の置換基で場合により置換されている5または6員複素環式環とすることができます。1つまたはそれ以上の置換基で場合により置換されている5または6員不飽和芳香族複素環式環の例と
40
50

しては、提示1に図示する環U-2～U-61が挙げられ、ここで、 R^V は、発明の概要において R^7 、 R^8 または R^9 について定義した任意の置換基（即ち、ハロゲン、C₁～C₄アルキルまたはC₁～C₄ハロアルキル）であり、rは0～4の整数であって、各U基上の利用可能な位置の数によって限定される。U-29、U-30、U-36、U-37、U-38、U-39、U-40、U-41、U-42およびU-43は利用可能な位置が1つしかないため、これらのU基についてはrは0または1の整数に限定され、rが0であるということは、U基が非置換であって、(R^V)_rで示される位置に水素が存在することを意味する。

【0030】

【化3】

10

提示1

U-1

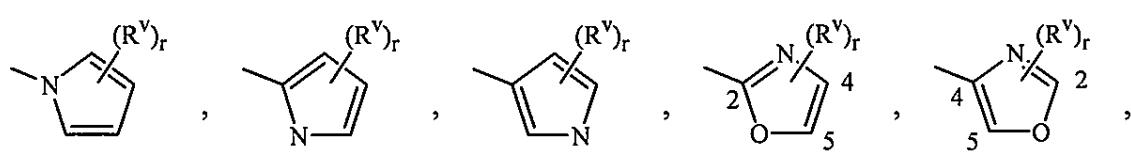
U-2

U-3

U-4

U-5

20



U-6

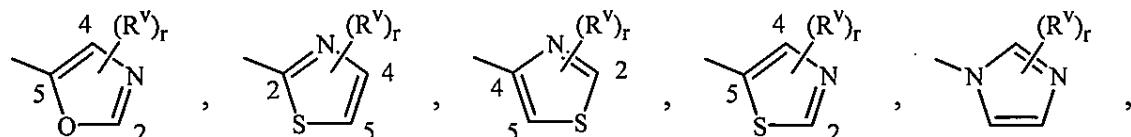
U-7

U-8

U-9

U-10

30



U-11

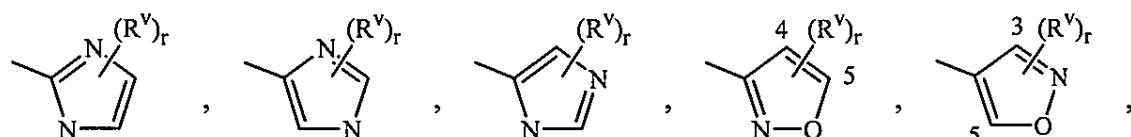
U-12

U-13

U-14

U-15

40



U-16

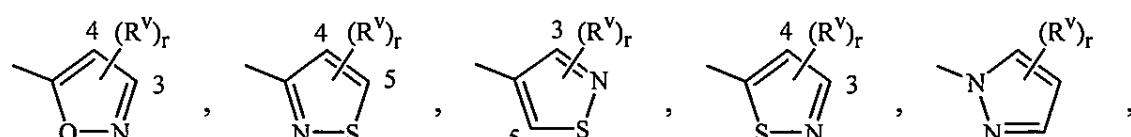
U-17

U-18

U-19

U-20

40



U-21

U-22

U-23

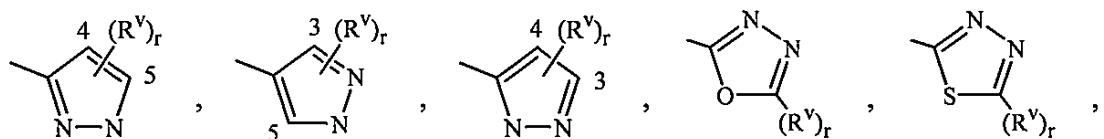
U-24

U-25

50

【0031】

【化4】



U-26

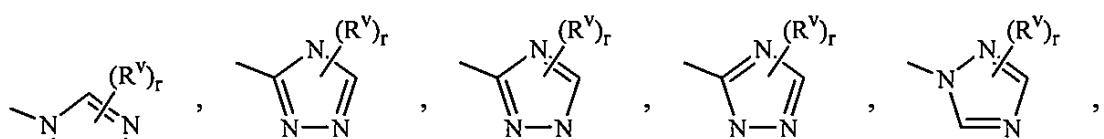
U-27

U-28

U-29

U-30

10



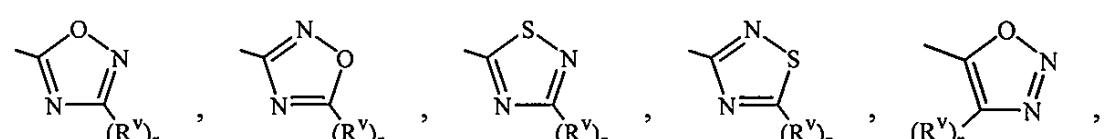
U-31

U-32

U-33

U-34

U-35



U-36

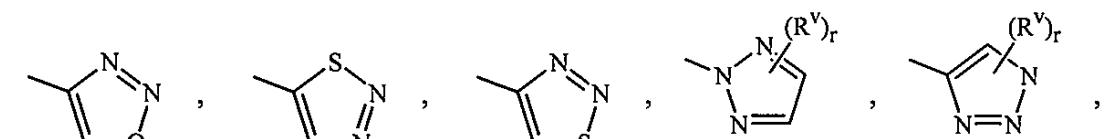
U-37

U-38

U-39

U-40

20



U-41

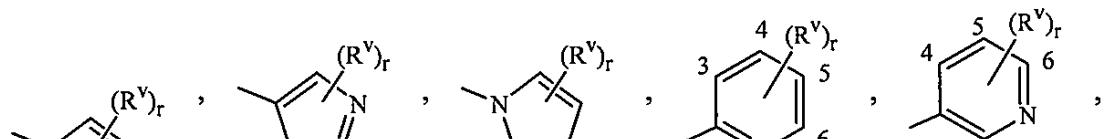
U-42

U-43

U-44

U-45

30



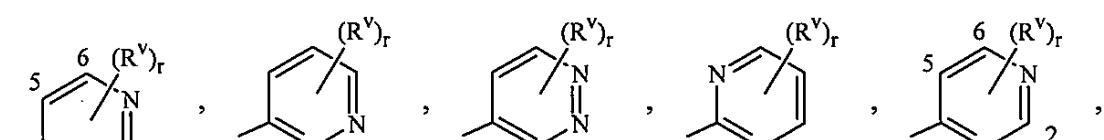
U-46

U-47

U-48

U-49

U-50



U-51

U-52

U-53

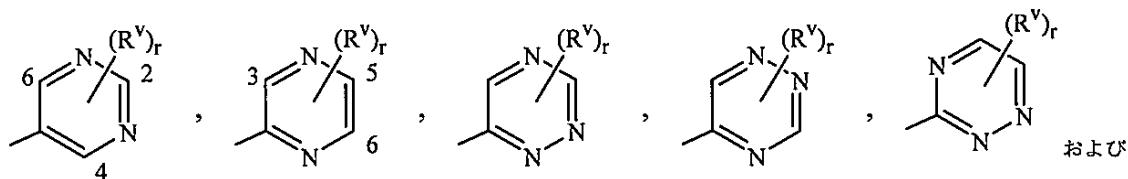
U-54

U-55

40

【0032】

【化5】



U-56

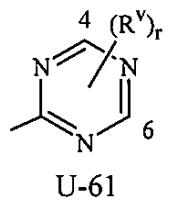
U-57

U-58

U-59

U-60

および



U-61

10

【0033】

R⁷、R⁸またはR⁹が発明の概要においてR⁷、R⁸またはR⁹について定義した置換基の群から選択される1つまたはそれ以上の置換基で場合により置換されている5または6員の飽和または不飽和非芳香族複素環式環である場合、複素環の炭素環員の1つまたは2つは、場合によりカルボニル部分の酸化形態であり得ることに留意されたい。

20

【0034】

2個以下のO原子および2個以下のS原子から選択される環員を含有し、炭素原子環員上で5個以下のハロゲン原子で場合により置換されている飽和または非芳香族不飽和複素環式環である5または6員の複素環式環の例としては、提示2に図示するような環T-1～T-35が挙げられる。T基上の結合点が浮遊しているものとして図示されている場合、T基は、T基の任意の利用可能な炭素または窒素を介し、水素原子の置換によって式1の残部に結合し得ることに留意されたい。R^vに対応する任意選択の置換基は、水素原子を置換することにより任意の利用可能な炭素または窒素に結合することができる。これらのT環の場合、rは典型的には0～4の整数であり、各T基上の利用可能な位置の数によって限定される。「場合により置換されている」という用語は、「置換されている、または置換されていない」という意味である。

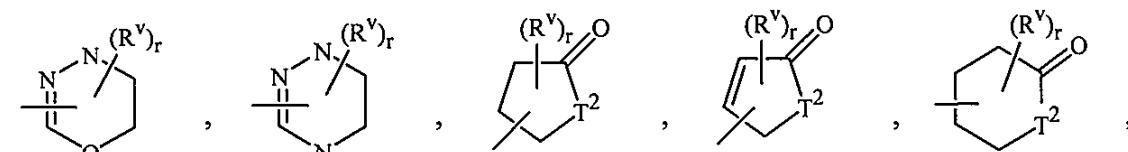
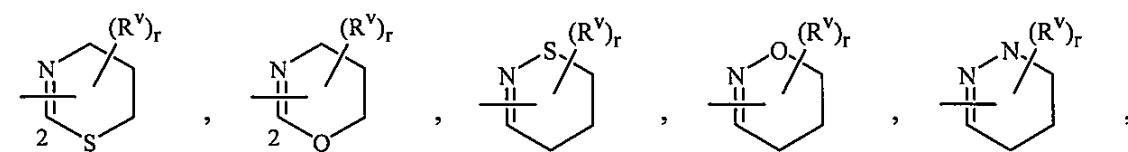
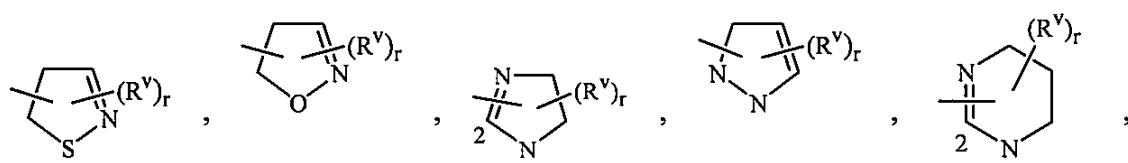
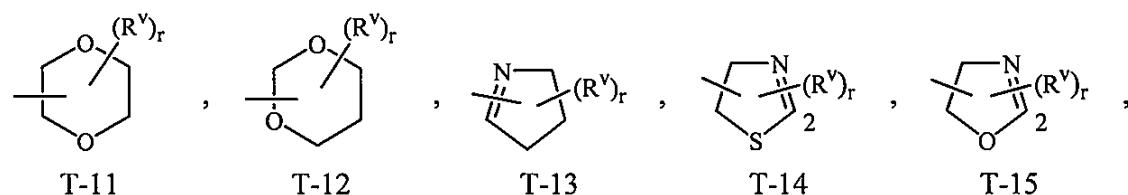
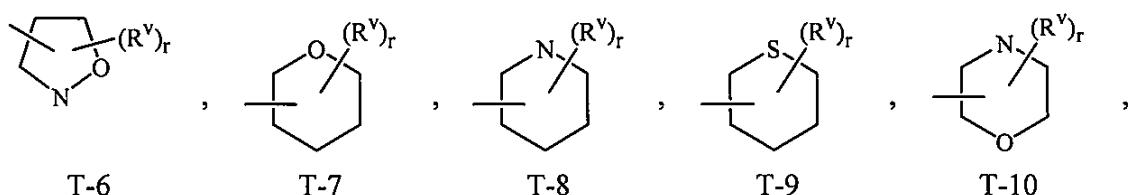
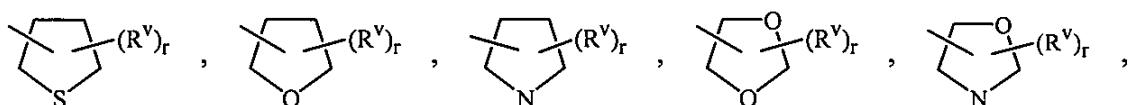
30

【0035】

R⁷、R⁸またはR⁹が、T-28～T-35から選択される環を含む場合、G²はO、SまたはNから選択されることに留意されたい。T²がNである場合、窒素原子は、Hまたは発明の概要においてR⁷、R⁸またはR⁹について定義したR^vに対応する置換基との置換によってその原子価を満たすことができることに留意されたい。R¹の例示的な値としては、T-1、T-2、T-7およびT-9が挙げられる。

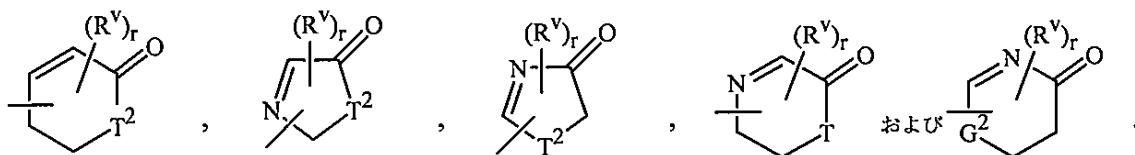
【0036】

【化6】

提示2

【0037】

【化7】



T-31

T-32

T-33

T-34

T-35

【0038】

構造 U - 1 ~ U - 6 1 に R^v 基が示されているが、これらは任意選択の置換基であるため、存在する必要はないことに留意されたい。 R^v が H であり原子に結合している場合、前記原子は非置換であるのと同じであることに留意されたい。置換して原子価を満たす必要のある窒素原子は、H または R^v で置換される。 $(R^v)_r$ と U 基との間の結合点が浮遊しているものとして図示されている場合、 $(R^v)_r$ は、U 基の任意の利用可能な炭素原子または窒素原子に結合可能であることに留意されたい。U 基上の結合点が浮遊しているものとして図示されている場合、U 基は、U 基の任意の利用可能な炭素または窒素を介し、水素原子の置換によって式 1 の残部に結合可能であることに留意されたい。U 基の一部は、4 個未満の R^v 基でのみ置換されることが可能であることに留意されたい（例えば、U - 2 ~ U - 5、U - 7 ~ U - 4 8、および U - 5 2 ~ U - 6 1）。

【0039】

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

【0040】

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

【0041】

実施形態 1 . 発明の概要に記載するような、式 1 の化合物、その N - オキシドおよび塩、それらを含有する組成物、ならびに望ましくない植生の防除のためのその使用方法。

【0042】

実施形態 2 . R^1 は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₈ アルキルカルボニルアルキル、C₃ ~ C₈ アルコキシカルボニルアルキル、C₄ ~ C₇ アルキルシクロアルキル、C₃ ~ C₇ アルケニル、C₃ ~ C₇ アルキニル、C₃ ~ C₇ シクロアルキルアルキル、C₂ ~ C₃ シアノアルキル、C₁ ~ C₄ ニトロアルキル、C₂ ~ C₇ ハロアルコキシアルキル、C₁ ~ C₇ ハロアルキル、C₃ ~ C₇ ハロアルケニル、C₂ ~ C₇ アルコキシアルキル、C₃ ~ C₇ アルキルチオアルキル、C₁ ~ C₇ アルコキシベンジルまたはフェニルである、実施形態 1 の化合物。

【0043】

実施形態 3 . R^1 は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₈ アルコキシカルボニルアルキル、C₄ ~ C₇ アルキルシクロアルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₄ ~ C₇ シクロアルキルアルキル、C₂ ~ C₃ シアノアルキル、C₁ ~ C₄ ニトロアルキル、C₂ ~ C₇ ハロアルコキシアルキル、C₁ ~ C₇ ハロアルキル、C₂ ~ C₇ アルコキシアルキル、C₃ ~ C₇ アルキルチオアルキル、C₁ ~ C₇ アルコキシまたはベンジルである、実施形態 1 または 2 の化合物。

【0044】

10

20

30

40

50

実施形態 4 . R¹ は、 C₁ ~ C₄ アルキル、 C₃ ~ C₄ シクロアルキル、 C₂ ~ C₃ シアノアルキル、 C₁ ~ C₃ ハロアルキルまたは C₂ ~ C₄ アルコキシアルキルである、実施形態 3 の化合物。

【 0 0 4 5 】

実施形態 5 . R¹ は、 C₁ ~ C₃ アルキル、 N C C H₂ C H₂ - 、 C₁ ~ C₂ ハロアルキルまたは 2 - メトキシエチルである、実施形態 4 の化合物。

【 0 0 4 6 】

実施形態 6 . R¹ は、メチル、エチル、n - プロピルまたは 2 - メトキシエチルである、実施形態 5 の化合物。

【 0 0 4 7 】

実施形態 7 . R¹ は、メチルまたはエチルである、実施形態 6 の化合物。

10

【 0 0 4 8 】

実施形態 8 . R¹ は、メチルである、実施形態 6 の化合物。

【 0 0 4 9 】

実施形態 9 . R¹ は、H 以外である、実施形態 1 の化合物。

【 0 0 5 0 】

実施形態 10 . R¹ は、フェニル以外である、実施形態 1 の化合物。

【 0 0 5 1 】

実施形態 11 . W は、O である、実施形態 1 ~ 10 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 0 5 2 】

20

実施形態 12 . A は、A - 1 、 A - 2 または A - 3 である、実施形態 1 ~ 11 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 0 5 3 】

実施形態 13 . A は、A - 3 である、実施形態 12 の化合物。

【 0 0 5 4 】

実施形態 14 . A は、A - 1 または A - 2 である、実施形態 12 の化合物。

【 0 0 5 5 】

実施形態 15 . A は、A - 1 である、実施形態 14 の化合物。

【 0 0 5 6 】

実施形態 16 . A は、A - 2 である、実施形態 14 の化合物。

30

【 0 0 5 7 】

実施形態 17 . A は、A - 3 または A - 4 である、実施形態 1 ~ 11 のいずれか 1 つの化合物。

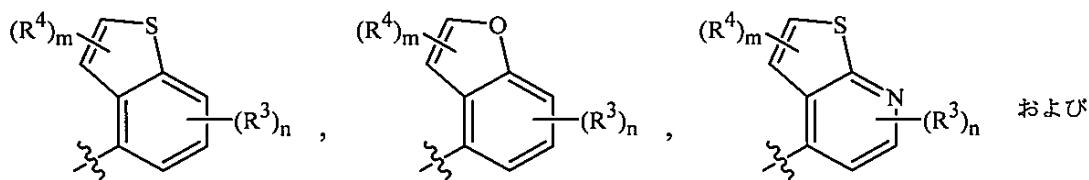
【 0 0 5 8 】

実施形態 18 . A は、A - 4 である、実施形態 17 の化合物。

【 0 0 5 9 】

実施形態 19 . A は、

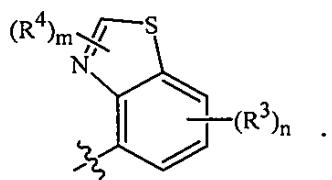
【化8】



A-1-A

A-1-B

A-1-C



A-1-D

から選択される、実施形態1～12、14または15のいずれか1つの化合物。

【0060】

実施形態20. Aは、A-1-AおよびA-1-Bから選択される、実施形態19の化合物。

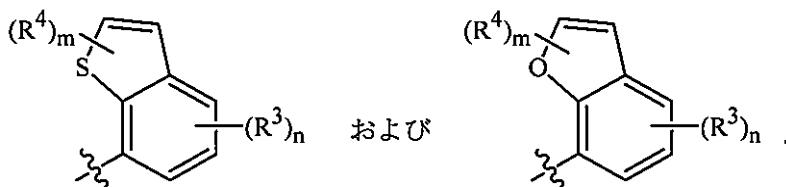
【0061】

実施形態21. Aは、A-1-Aである、実施形態20の化合物。

【0062】

実施形態22. Aは、

【化9】



A-2-A

A-2-B

から選択される、実施形態1～12、14または16のいずれか1つの化合物。

【0063】

実施形態23. Aは、A-2-Aである、実施形態22の化合物。

【0064】

実施形態24.

mは、0または1であり；

nは、0または1である、

実施形態19～23のいずれか1つの化合物。

【0065】

実施形態25.

mは、1であり、OまたはSヘテロ原子に隣接する位置に位置し；

nは、1であり、式1の残部の結合点に隣接する位置に位置する、

実施形態24の化合物。

【0066】

実施形態26.

mは、0であり；

nは、1である、

10

20

30

40

50

実施形態 2 4 の化合物。

【0067】

実施形態 2 7 .

m は、 1 であり；

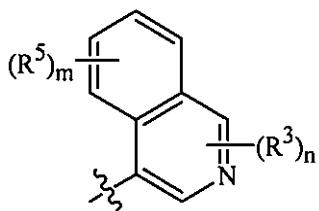
n は、 0 である、

実施形態 2 4 の化合物。

【0068】

実施形態 2 8 . A は、

【化10】



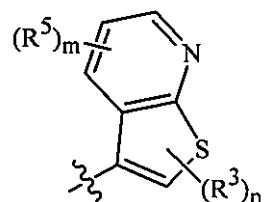
A-3-A

である、実施形態 1 ~ 13、または 17 のいずれか 1 つの化合物。

【0069】

実施形態 2 9 . A は、

【化11】



A-4-A

である、実施形態 1 ~ 11、17 または 18 のいずれか 1 つの化合物。

【0070】

実施形態 3 0 .

m は、 0 または 1 であり；

n は、 0 または 1 である、

実施形態 2 8 または 2 9 の化合物。

【0071】

実施形態 3 1 .

m は、 0 であり；

n は、 1 である、

実施形態 3 0 の化合物。

【0072】

実施形態 3 2 .

m は、 1 であり；

n は、 0 である、

実施形態 3 0 の化合物。

【0073】

実施形態 3 3 . G¹ は、 H、 - C (= O) R⁷、 - C (= S) R⁷、 - CO₂ R⁸、 - C (= O) SR⁸、 - CONR⁹ R¹⁰ もしくは P (= O) R¹¹；または C₁ ~ C₄ アルキル、C₂ ~ C₄ アルケニル、C₂ ~ C₄ アルキニル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、C₂ ~ C₄ ハロアルケニル、C₂ ~ C₄ ハロアルキニル、C₁ ~ C₄ アルコキシアルキル、C

10

20

30

40

50

$C_3 \sim C_6$ シクロアルキルもしくは $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキルである、実施形態 1 ~ 3 2 のいずれか 1 つの化合物。

【0074】

実施形態 34 . G¹ は、 H、 - C(=O)R⁷、 - CO₂R⁸、 - CONR⁹R¹⁰ もしくは P(=O)R¹¹；または $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルもしくは $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキルである、実施形態 33 の化合物。

【0075】

実施形態 35 . G¹ は、 H、 - C(=O)R⁷、 - CO₂R⁸ もしくは P(=O)R¹ 10
1；または $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシアルキルもしくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルである、実施形態 34 の化合物。

【0076】

実施形態 36 . G¹ は、 H、 - C(=O)R⁷、 - CO₂R⁸；または $C_1 \sim C_4$ アルコキシアルキルもしくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルである、実施形態 35 の化合物。

【0077】

実施形態 37 . G¹ は、 H である、実施形態 36 の化合物。

【0078】

実施形態 38 . G¹ は、 - C(=O)R⁷ である、実施形態 36 の化合物。

【0079】

実施形態 39 . G¹ は、 - CO₂R⁸ である、実施形態 36 の化合物。

【0080】

実施形態 40 . G¹ は、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシアルキルである、実施形態 36 の化合物。

【0081】

実施形態 41 . G¹ は、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルである、実施形態 36 の化合物。

【0082】

実施形態 42 . G は、 G¹ である、実施形態 1 ~ 4 1 のいずれか 1 つの化合物。

【0083】

実施形態 43 . G は、 W¹ G¹ である、実施形態 1 ~ 4 1 のいずれか 1 つの化合物。

【0084】

実施形態 44 . W¹ は、 $C_1 \sim C_2$ アルカンジイルまたは $C_2 \sim C_3$ アルケンジイルである、実施形態 43 の化合物。

【0085】

実施形態 45 . W¹ は、 - CH₂- または - CH=CH- である、実施形態 44 の化合物。

【0086】

実施形態 46 . W¹ は、 - CH₂- である、実施形態 45 の化合物。

【0087】

実施形態 47 . R² は、 H、 ハロゲン、 - CN、 - CHO、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシカルボニルアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_7$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_4 \sim C_7$ アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_7$ ハロアルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_5$ アルキルチオである、実施形態 1 ~ 4 6 のいずれか 1 つの化合物。

【0088】

10

20

30

40

50

実施形態 48 . R² は、H、ハロゲン、-CN、-CHO、C₁ ~ C₇ アルキル、C₁ ~ C₄ アルキルカルボニル、C₂ ~ C₇ アルキルカルボニルオキシ、C₄ ~ C₇ アルキルシクロアルキル、C₁ ~ C₄ アルキルスルフィニル、C₁ ~ C₄ アルキルスルホニル、C₁ ~ C₄ アルキルアミノ、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₄ ~ C₇ シクロアルキルアルキル、C₂ ~ C₃ シアノアルキル、C₁ ~ C₄ ニトロアルキル、C₂ ~ C₇ ハロアルコキシアルキル、C₁ ~ C₇ ハロアルキル、C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルまたはC₁ ~ C₇ アルコキシである、実施形態 47 の化合物。

【0089】

実施形態 49 . R² は、H、ハロゲン、-CN、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、C₁ ~ C₃ ハロアルキル、C₂ ~ C₄ アルコキシアルキルまたはC₁ ~ C₃ アルコキシである、実施形態 48 の化合物。 10

【0090】

実施形態 50 . R² は、H、ハロゲン、-CN、C₁ ~ C₃ アルキル、シクロプロピル、C₁ ~ C₂ ハロアルキル、メトキシまたはエトキシである、実施形態 49 の化合物。

【0091】

実施形態 51 . R² は、H、Cl、Br、I、-CN、メチルまたはメトキシである、実施形態 50 の化合物。

【0092】

実施形態 52 . R² は、H、Cl、メチルまたはメトキシである、実施形態 51 の化合物。 20

【0093】

実施形態 53 . R² は、Cl またはメチルである、実施形態 52 の化合物。

【0094】

実施形態 54 . R² は、H 以外である、実施形態 1 ~ 52 のいずれか 1 つの化合物。

【0095】

実施形態 55 . R² は、フェニル以外である、実施形態 1 ~ 52 のいずれか 1 つの化合物。

【0096】

実施形態 56 . 各 X¹ は、独立して N である、実施形態 1 ~ 55 のいずれか 1 つの化合物。 30

【0097】

実施形態 57 . 各 X¹ は、独立して CR³ である、実施形態 1 ~ 55 のいずれか 1 つの化合物。

【0098】

実施形態 58 . 各 X² は、独立して N である、実施形態 1 ~ 57 のいずれか 1 つの化合物。

【0099】

実施形態 59 . 各 X² は、独立して CR³ である、実施形態 1 ~ 57 のいずれか 1 つの化合物。

【0100】

実施形態 60 . 各 X³ は、独立して N である、実施形態 1 ~ 59 のいずれか 1 つの化合物。

【0101】

実施形態 61 . 各 X³ は、独立して CR³ である、実施形態 1 ~ 59 のいずれか 1 つの化合物。

【0102】

実施形態 62 . 各 X⁴ は、独立して N である、実施形態 1 ~ 61 のいずれか 1 つの化合物。

【0103】

実施形態 63 . 各 X⁴ は、独立して CR⁴ である、実施形態 1 ~ 61 のいずれか 1 つの

50

化合物。

【0104】

実施形態64. 各 X^5 は、独立してNである、実施形態1～63のいずれか1つの化合物。

【0105】

実施形態65. 各 X^5 は、独立してCR⁴である、実施形態1～63のいずれか1つの化合物。

【0106】

実施形態66. 各 X^6 は、独立してNである、実施形態1～65のいずれか1つの化合物。

10

【0107】

実施形態67. 各 X^6 は、独立してCR⁴である、実施形態1～65のいずれか1つの化合物。

【0108】

実施形態68. X⁷、X⁸、X⁹およびX¹⁰は、-CH=CH-CH=CH-として一緒になる（即ち、A-3またはA-4の残部と一緒にになって環を形成する）、実施形態1～67のいずれか1つの化合物。

【0109】

実施形態69. X⁷、X⁸、X⁹およびX¹⁰は、-N=CH-CH=CH-として一緒になる（即ち、A-3またはA-4の残部と一緒にになって環を形成する）、実施形態1～67のいずれか1つの化合物。

20

【0110】

実施形態70. X⁷、X⁸、X⁹およびX¹⁰は、-C(CH₃)=CH-CH=CH-として一緒になる（即ち、A-3またはA-4の残部と一緒にになって環を形成する）、実施形態1～67のいずれか1つの化合物。

【0111】

実施形態71. X⁷、X⁸、X⁹およびX¹⁰は、-CH=CH-N=CH-として一緒になる（即ち、A-3またはA-4の残部と一緒にになって環を形成する）、実施形態1～67のいずれか1つの化合物。

【0112】

30

実施形態72. X⁷、X⁸、X⁹およびX¹⁰は、-CH=CH-C(CH₃)=CH-として一緒になる（即ち、A-3またはA-4の残部と一緒にになって環を形成する）、実施形態1～67のいずれか1つの化合物。

【0113】

実施形態73. Y¹は、OまたはSである、実施形態1～72のいずれか1つの化合物。

【0114】

実施形態74. Y¹は、Oである、実施形態73の化合物。

【0115】

実施形態75. Y¹は、Sである、実施形態73の化合物。

40

【0116】

実施形態76. Y²は、OまたはSである、実施形態1～72のいずれか1つの化合物。

【0117】

実施形態77. Y²は、Oである、実施形態76の化合物。

【0118】

実施形態78. Y²は、Sである、実施形態76の化合物。

【0119】

実施形態79. Y⁴は、OまたはSである、実施形態1～72のいずれか1つの化合物。

50

【0120】

実施形態80. Y^4 は、Oである、実施形態79の化合物。

【0121】

実施形態81. Y^4 は、Sである、実施形態79の化合物。

【0122】

実施形態82. 各 R^3 は、独立してH、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_4$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ ハロアルキルまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシである、式1または実施形態1～81のいずれか1つの化合物。

【0123】

実施形態83. 各 R^3 は、独立してH、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキル、シクロプロピルまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルキルである、実施形態82の化合物。 10

【0124】

実施形態84. 各 R^3 は、独立してH、ハロゲン、メチル、エチルまたは CF_3 である、実施形態83の化合物。

【0125】

実施形態85. 各 R^3 は、独立してH、F、Cl、Brまたはメチルである、実施形態84の化合物。

【0126】

実施形態86. 各 R^3 は、独立してHである、実施形態85の化合物。

【0127】

実施形態87. 各 R^4 は、独立してH、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_4$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ ハロアルキルまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシである、実施形態1～86のいずれか1つの化合物。 20

【0128】

実施形態88. 各 R^4 は、独立してH、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキル、シクロプロピルまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルキルである、実施形態87の化合物。

【0129】

実施形態89. 各 R^4 は、独立してH、ハロゲン、メチル、エチルまたは CF_3 である、実施形態88の化合物。

【0130】

実施形態90. 各 R^4 は、独立してH、メチルまたはエチルである、実施形態89の化合物。 30

【0131】

実施形態91. R^4 は、メチルである、実施形態90の化合物。

【0132】

実施形態92. 各 R^5 は、独立してH、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_4$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ ハロアルキルまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシである、実施形態1～86のいずれか1つの化合物。

【0133】

実施形態93. 各 R^5 は、独立してH、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキル、シクロプロピルまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ ハロアルキルである、実施形態92の化合物。 40

【0134】

実施形態94. 各 R^5 は、独立してH、ハロゲン、メチル、エチルまたは CF_3 である、実施形態93の化合物。

【0135】

実施形態95. 各 R^5 は、独立してH、メチルまたはエチルである、実施形態94の化合物。

【0136】

実施形態96. R^5 は、Hである、実施形態95の化合物。

【0137】

実施形態 97 . R⁶ は、H または C₁ ~ C₃ アルキルである、実施形態 1 ~ 96 のいずれか 1 つの化合物。

【0138】

実施形態 98 . R⁶ は、H または C H₃ である、実施形態 97 の化合物。

【0139】

実施形態 99 . R⁶ は、C H₃ である、実施形態 98 の化合物。

【0140】

実施形態 100 . R⁷ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₁ ~ C₃ ハロアルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルである、実施形態 1 ~ 99 のいずれか 1 つの化合物。 10

【0141】

実施形態 101 . R⁷ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルである、実施形態 100 の化合物。

【0142】

実施形態 102 . R⁷ は、C₁ ~ C₇ アルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルである、実施形態 101 の化合物。

【0143】

実施形態 103 . R⁷ は、独立して C₁ ~ C₃ アルキルまたは C₂ ~ C₄ アルコキシアルキルである、実施形態 102 の化合物。 20

【0144】

実施形態 104 . R⁸ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₁ ~ C₃ ハロアルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルである、実施形態 1 ~ 99 のいずれか 1 つの化合物。

【0145】

実施形態 105 . R⁸ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルである、実施形態 104 の化合物。

【0146】

実施形態 106 . R⁸ は、C₁ ~ C₇ アルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルである、実施形態 105 の化合物。 30

【0147】

実施形態 107 . R⁸ は、C₁ ~ C₃ アルキルまたは C₂ ~ C₄ アルコキシアルキルである、実施形態 106 の化合物。

【0148】

実施形態 108 . R⁹ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₂ ~ C₃ ハロアルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルである、実施形態 1 ~ 99 のいずれか 1 つの化合物。

【0149】

実施形態 109 . R⁹ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルである、実施形態 108 の化合物。 40

【0150】

実施形態 110 . R⁹ は、C₁ ~ C₇ アルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルである、実施形態 109 の化合物。

【0151】

実施形態 111 . R¹⁰ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₁ ~ C₃ ハロアルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルである、実施形態 1 ~ 99 のいずれか 1 つの化合物。

【0152】

実施形態 112 . R¹⁰ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルである、実施形態 111 の化合物。

【0153】

10

20

30

40

50

実施形態 113 . R¹ は、 C₁ ~ C₃ アルキルまたは C₁ ~ C₃ アルコキシである、実施形態 1 ~ 99 のいずれか 1 つの化合物。

【0154】

実施形態 114 . R¹ は、 CH₃ または OCH₃ である、実施形態 113 の化合物。

【0155】

実施形態 115 . R¹ は、 OCH₃ である、実施形態 114 の化合物。

【0156】

実施形態 116 . A が A - 1 であり、 R¹ が CH₃ であり、 R² が CH₃ であり、 G が G¹ であり、 G¹ が H であり、 X¹ が CBr であり、 X² および X³ がいずれも CH であり、 X⁵ が N であり、 X⁶ が N である場合、 Y¹ は、 N - CH₃ 以外である、式 1 の化合物。 10

【0157】

実施形態 117 . A が A - 1 であり、 R¹ が CH₃ であり、 R² が Cl であり、 G が G¹ であり、 G¹ が H であり、 各 X¹ 、 X² および X³ が CH であり、 X⁵ が N であり、 X⁶ が N である場合、 Y¹ は、 N - CH₃ 以外である、式 1 の化合物。

【0158】

実施形態 118 . A が A - 1 であり、 R¹ が CH₃ であり、 R² が CH₃ であり、 G が G¹ であり、 G¹ が -C(=O)R⁷ であり、 R⁷ がフェニルであり、 X¹ 、 X² がいずれも CH であり、 X³ が CCl であり、 X⁵ が CCH₃ であり、 X⁶ が CH である場合、 Y¹ は、 O 以外である、式 1 の化合物。 20

【0159】

実施形態 119 . A が A - 1 であり、 R¹ が CH₃ であり、 R² が Cl であり、 G が G¹ であり、 G¹ が H であり、 X¹ 、 X² 、 X³ が CH であり、 X⁵ が N であり、 X⁶ が N である場合、 Y¹ は、 N - CH₃ 以外である、式 1 の化合物。

【0160】

実施形態 120 . A が A - 3 であり、 R¹ が CH₃ であり、 R² が H であり、 G が G¹ であり、 G¹ が H であり、 各 X¹ 、 X² 、 X³ 、 X⁷ 、 X⁹ および X¹⁰ が CH である場合、 X⁸ は、 N 以外である、式 1 の化合物。

【0161】

実施形態 121 . R² は、ハロゲン、 C₁ ~ C₇ アルキル、 C₁ ~ C₄ アルキルアミノ、 C₂ ~ C₈ ジアルキルアミノまたは C₃ ~ C₇ シクロアルキルである、実施形態 47 の化合物。 30

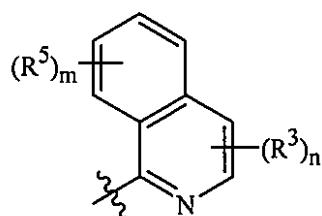
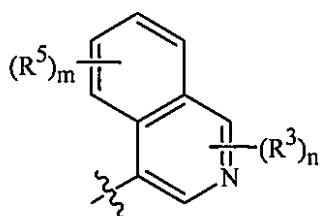
【0162】

実施形態 122 . R² は、 C₁ ~ C₄ アルキルアミノまたは C₂ ~ C₈ ジアルキルアミノである、実施形態 121 の化合物。

【0163】

実施形態 123 . A は、

【化12】



である、実施形態 1 ~ 13 、または 17 のいずれか 1 つの化合物。

【0164】

実施形態 124 . A は、 A - 1 、 A - 2 または A - 4 である、実施形態 1 ~ 11 のいず 50

れか 1 つの化合物。

【 0 1 6 5 】

実施形態 125 . A が A - 4 であり ; Y⁴ が O、S または N R⁶ であり ; R⁶ が H、C₁ ~ C₃ アルキルまたは C₁ ~ C₃ ハロアルキル以外である場合 ; X⁷、X⁸、X⁹ および X¹⁰ のうちの少なくとも 1 つは、C R⁵ 以外である、式 1 の化合物。

【 0 1 6 6 】

実施形態 126 . A が A - 3 であり ; R¹ が C H₃ であり ; G が H または C (= O) C H₃ であり ; R² が C₁ または Br である場合、各 X² および X³ は、独立して C R³ であり ; 各 X⁷、X⁸ および X⁹ は、独立して C R⁵ である、式 1 の化合物。

【 0 1 6 7 】

実施形態 127 . A が A - 3 であり ; R¹ が C H₃ であり ; G が H または C (= O) C H₃ であり ; R² が C₁ または Br であり ; X²、X³、X⁷、X⁸ または X⁹ のいずれか 1 つが N である場合、第 2 の X²、X³、X⁷、X⁸ または X⁹ は、N または C R³ であり、R³ は、H 以外である、式 1 の化合物。

【 0 1 6 8 】

本発明の実施形態は、上記実施形態 1 ~ 127 だけでなく本明細書に記載する他の任意の実施形態も含め、どのように組み合わせることも可能であり、実施形態における可変要素についての説明は、式 1 の化合物だけでなく、式 1 の化合物の製造に有用な出発化合物および中間化合物にも関連する。加えて、本発明の実施形態は、上記実施形態 1 ~ 127 だけでなく本明細書に記載する他の任意の実施形態およびそれらの任意の組合せも含め、本発明の組成物および方法に関連する。

【 0 1 6 9 】

実施形態 A .

R¹ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₈ アルキルカルボニルアルキル、C₃ ~ C₈ アルコキシカルボニルアルキル、C₄ ~ C₇ アルキルシクロアルキル、C₃ ~ C₇ アルケニル、C₃ ~ C₇ アルキニル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₄ ~ C₇ シクロアルキルアルキル、C₂ ~ C₃ シアノアルキル、C₁ ~ C₄ ニトロアルキル、C₂ ~ C₇ ハロアルコキシアルキル、C₁ ~ C₇ ハロアルキル、C₃ ~ C₇ ハロアルケニル、C₂ ~ C₇ アルコキシアルキル、C₃ ~ C₇ アルキルチオアルキル、C₁ ~ C₇ アルコキシ、ベンジルまたはフェニルであり；

W は、O であり；

A は、A - 1、A - 2 または A - 3 であり；

G¹ は、H、- C (= O) R⁷、- C (= S) R⁷、- CO₂ R⁸、- C (= O) SR⁸、- CONR⁹ R¹⁰ もしくは P (= O) R¹¹；または C₁ ~ C₄ アルキル、C₂ ~ C₄ アルケニル、C₂ ~ C₄ アルキニル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、C₂ ~ C₄ ハロアルケニル、C₂ ~ C₄ ハロアルキニル、C₁ ~ C₄ アルコキシアルキル、C₃ ~ C₆ シクロアルキルもしくは C₄ ~ C₇ シクロアルキルアルキルであり；

W¹ は、C₁ ~ C₂ アルカンジイルまたは C₂ ~ C₃ アルケンジイルであり；

R² は、H、ハロゲン、- CN、- CHO、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₈ アルキルカルボニルアルキル、C₃ ~ C₈ アルコキシカルボニルアルキル、C₁ ~ C₄ アルキルカルボニル、C₂ ~ C₇ アルキルカルボニルオキシ、C₄ ~ C₇ アルキルシクロアルキル、C₃ ~ C₇ アルケニル、C₃ ~ C₇ アルキニル、C₁ ~ C₄ アルキルスルフィニル、C₁ ~ C₄ アルキルスルホニル、C₁ ~ C₄ アルキルアミノ、C₂ ~ C₈ ジアルキルアミノ、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₄ ~ C₇ シクロアルキルアルキル、C₂ ~ C₃ シアノアルキル、C₁ ~ C₄ ニトロアルキル、C₂ ~ C₇ ハロアルコキシアルキル、C₁ ~ C₇ ハロアルキル、C₃ ~ C₇ ハロアルケニル、C₂ ~ C₇ アルコキシアルキル、C₁ ~ C₇ アルコキシまたは C₁ ~ C₅ アルキルチオであり；

各 X¹ は、独立して C R³ であり；

各 R³ は、独立して H、ハロゲン、C₁ ~ C₃ アルキル、C₃ ~ C₄ シクロアルキル、C₁ ~ C₃ ハロアルキルまたは C₁ ~ C₃ アルコキシであり；

10

20

30

40

50

各 R⁴ は、独立して H、ハロゲン、C₁ ~ C₃ アルキル、C₃ ~ C₄ シクロアルキル、C₁ ~ C₃ ハロアルキルまたは C₁ ~ C₃ アルコキシであり；

各 R⁵ は、独立して H、ハロゲン、C₁ ~ C₃ アルキル、C₃ ~ C₄ シクロアルキル、C₁ ~ C₃ ハロアルキルまたは C₁ ~ C₃ アルコキシであり；

R⁶ は、H または C₁ ~ C₃ アルキルであり；

R⁷ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₁ ~ C₃ ハロアルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルであり；

R⁸ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₁ ~ C₃ ハロアルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルであり；

R⁹ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₂ ~ C₃ ハロアルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキル 10 であり；

R¹⁰ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₁ ~ C₃ ハロアルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルであり；

R¹¹ は、C₁ ~ C₃ アルキルまたは C₁ ~ C₃ アルコキシである、

式 1 の化合物、その N - オキシドおよび塩、それらを含有する組成物、ならびに望ましくない植生の防除のためのその使用方法。

【0170】

実施形態 B .

R¹ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₈ アルコキシカルボニルアルキル、C₄ ~ C₇ アルキルシクロアルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₄ ~ C₇ シクロアルキルアルキル、C₂ ~ C₃ シアノアルキル、C₁ ~ C₄ ニトロアルキル、C₂ ~ C₇ ハロアルコキシアルキル、C₁ ~ C₇ ハロアルキル、C₂ ~ C₇ アルコキシアルキル、C₃ ~ C₇ アルキルチオアルキル、C₁ ~ C₇ アルコキシまたはベンジルであり；

A は、A - 1 または A - 2 であり；

G¹ は、H、- C(=O)R⁷、- CO₂R⁸、- CONR⁹R¹⁰ もしくは P(=O)R¹¹；または C₁ ~ C₄ アルキル、C₂ ~ C₄ アルケニル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、C₂ ~ C₄ ハロアルケニル、C₁ ~ C₄ アルコキシアルキル、C₃ ~ C₆ シクロアルキルもしくは C₄ ~ C₇ シクロアルキルアルキルであり；

W¹ は、- CH₂- または - CH=CH- であり；

R² は、H、ハロゲン、- CN、- CHO、C₁ ~ C₇ アルキル、C₁ ~ C₄ アルキルカルボニル、C₂ ~ C₇ アルキルカルボニルオキシ、C₄ ~ C₇ アルキルシクロアルキル、C₁ ~ C₄ アルキルスルフィニル、C₁ ~ C₄ アルキルスルホニル、C₁ ~ C₄ アルキルアミノ、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₄ ~ C₇ シクロアルキルアルキル、C₂ ~ C₃ シアノアルキル、C₁ ~ C₄ ニトロアルキル、C₂ ~ C₇ ハロアルコキシアルキル、C₁ ~ C₇ ハロアルキル、C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルまたは C₁ ~ C₇ アルコキシであり；

各 X² は、独立して CR³ であり；

各 X⁵ は、独立して CR⁴ であり；

Y¹ は、O または S であり；

Y² は、O または S であり；

各 R³ は、独立して H、ハロゲン、C₁ ~ C₂ アルキル、シクロプロピルまたは C₁ ~ C₂ ハロアルキルであり；

各 R⁴ は、独立して H、ハロゲン、C₁ ~ C₂ アルキル、シクロプロピルまたは C₁ ~ C₂ ハロアルキルであり；

R⁷ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルであり；

R⁸ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルであり；

R⁹ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキルまたは C₂ ~ C₇ アルコキシアルキルであり；

20

30

40

50

R¹⁰は、H、C₁～C₇アルキル、C₃～C₇シクロアルキルまたはC₂～C₇アルコキシアルキルであり；

R¹¹は、CH₃またはOCH₃である、
実施形態Aの化合物。

【0171】

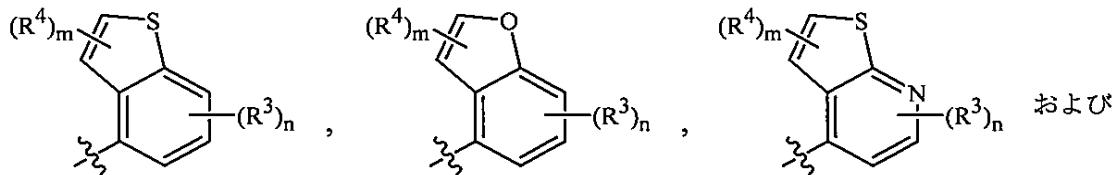
実施形態C.

R¹は、C₁～C₄アルキル、C₃～C₄シクロアルキル、C₂～C₃シアノアルキル
、C₁～C₃ハロアルキルまたはC₂～C₄アルコキシアルキルであり；

Aは、

【化13】

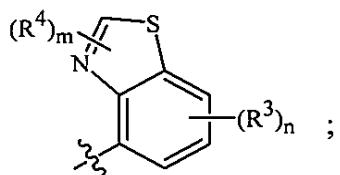
10



A-1-A

A-1-B

A-1-C



A-1-D

20

から選択され；

G¹は、H、-C(=O)R⁷、-CO₂R⁸もしくはP(=O)R¹¹；またはC₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₁～C₄アルコキシアルキルもしくはC₃～C₆シクロアルキルであり；

W¹は、-CH₂-であり；

30

R²は、H、ハロゲン、-CN、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキル、C₁～C₃ハロアルキル、C₂～C₄アルコキシアルキルまたはC₁～C₃アルコキシであり；

各R³は、独立してH、ハロゲン、メチル、エチルまたはCF₃であり；

各R⁴は、独立してH、ハロゲン、メチル、エチルまたはCF₃であり；

R⁷は、C₁～C₇アルキルまたはC₂～C₇アルコキシアルキルであり；

R⁸は、C₁～C₇アルキルまたはC₂～C₇アルコキシアルキルであり；

R¹¹は、OCH₃である、

実施形態Bの化合物。

【0172】

40

実施形態D.

R¹は、メチル、エチル、n-プロピルまたは2-メトキシエチルであり；

Aは、A-1-AおよびA-1-Bから選択され；

Gは、G¹であり；

G¹は、H、-C(=O)R⁷、-CO₂R⁸；またはC₁～C₄アルコキシアルキルもしくはC₃～C₆シクロアルキルであり；

R²は、H、Cl、Br、I、-CN、メチルまたはメトキシであり；

各R³は、独立してH、F、Cl、Brまたはメチルであり；

各R⁴は、独立してH、メチルまたはエチルであり；

R⁷は、C₁～C₃アルキルまたはC₂～C₄アルコキシアルキルであり；

50

R^8 は、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_2 \sim C_4$ アルコキシアルキルである、実施形態Cの化合物。

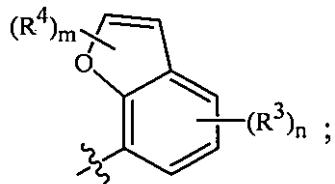
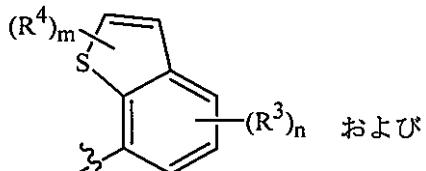
【0173】

実施形態E.

R^1 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_4$ アルコキシアルキルであり；

Aは、

【化14】



A-2-A

A-2-B

10

から選択され；

G^1 は、H、-C(=O)R⁷、-CO₂R⁸もしくはP(=O)R¹¹；または $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシアルキルもしくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；

W^1 は、-CH₂-であり；

R^2 は、H、ハロゲン、-CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ アルコキシであり；

各 R^3 は、独立してH、ハロゲン、メチル、エチルまたはCF₃であり；

各 R^4 は、独立してH、ハロゲン、メチル、エチルまたはCF₃であり；

R^7 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^8 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^{11} は、OCH₃である、

20

実施形態Bの化合物。

【0174】

実施形態F.

R^1 は、メチル、エチル、n-プロピルまたは2-メトキシエチルであり；

Aは、A-2-Aであり；

Gは、G¹であり；

G^1 は、H、-C(=O)R⁷、-CO₂R⁸；または $C_1 \sim C_4$ アルコキシアルキルもしくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；

R^2 は、H、Cl、Br、I、-CN、メチルまたはメトキシであり；

各 R^3 は、独立してH、F、Cl、Brまたはメチルであり；

各 R^4 は、独立してH、メチルまたはエチルであり；

R^7 は、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_2 \sim C_4$ アルコキシアルキルであり；

R^8 は、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_2 \sim C_4$ アルコキシアルキルである、

40

実施形態Eの化合物。

【0175】

特定の実施形態は、以下からなる群から選択される式1の化合物を含む：

4-(2,6-ジメチル-7-ベンゾフラニル)-5-ヒドロキシ-2,6-ジメチル-3(2H)-ピリダジノン(化合物10)；

5-(アセチルオキシ)-4-(2,6-ジメチル-7-ベンゾフラニル)-2,6-ジメチル-3(2H)-ピリダジノン(化合物11)；

50

5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 4 - (3 - メチル - 1 , 2 - ベンゾイソチアゾール - 4 - イル) - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 25) ;

5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 4 - (5 - メチルベンゾ [b] チエン - 4 - イル) - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 29) ; および

1 , 6 - ジヒドロ - 1 , 3 - ジメチル - 5 - (5 - メチルベンゾ [b] チエン - 4 - イル) - 6 - オキソ - 4 - ピリダジニルエチルカルボナート (化合物 30) 。

【 0176 】

特定の実施形態は、以下からなる群から選択される式 1 の化合物を含む :

4 - (2 , 6 - ジメチル - 7 - ベンゾフラニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 10) ;

5 - (アセチルオキシ) - 4 - (2 , 6 - ジメチル - 7 - ベンゾフラニル) - 2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 11) ; および

5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 4 - (3 - メチル - 1 , 2 - ベンゾイソチアゾール - 4 - イル) - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 25) 。

【 0177 】

本発明の特定の実施形態は、以下である式 1 の化合物である :

4 - (2 , 6 - ジメチル - 7 - ベンゾフラニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 10) 。

【 0178 】

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

【 0179 】

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

【 0180 】

本発明は、(a) 式 1 から選択される化合物、その N - オキシドおよび塩と、(b) (b 1) 光化学系 I I 阻害剤、(b 2) アセトヒドロキシ酸シンターゼ (A H A S) 阻害剤、(b 3) アセチル - C o A カルボキシラーゼ (A C C a s e) 阻害剤、(b 4) オーキシン模倣体、(b 5) 5 - エノール - ピルビルシキミ酸 - 3 - リン酸 (E P S P) シンターゼ阻害剤、(b 6) 光化学系 I 電子ダイバータ、(b 7) プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼ (P P O) 阻害剤、(b 8) グルタミンシンセターゼ (G S) 阻害剤、(b 9) 超長鎖脂肪酸 (V L C F A) エロンガーゼ阻害剤、(b 10) オーキシン輸送阻害剤、(b 11) フイトエンデサチュラーゼ (P D S) 阻害剤、(b 12) 4 - ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ (H P P D) 阻害剤、(b 13) ホモゲンチジン酸ソラネシルトランスフェラーゼ (H S T) 阻害剤、(b 14) セルロース生合成阻害剤、(b 15) 有糸分裂搅乱物質、有機ヒ素剤、アシュラム、プロモブチド、シンメシリソ、クミルロン、ダゾメット、ジフェンゾコート、ダイムロン、エトベンザニド、フルレノール、ホサミン、ホサミン - アンモニウム、ヒダントシジン、メタム、メチルダイムロン、オレイン酸、オキサジクロメフォン、ペラルゴン酸およびピリブチカルブを含む他の除草剤、および (b 16) 除草剤薬害軽減剤；ならびに (b 1) ~ (b 16) の化合物の塩から選択される少なくとも 1 種の追加の有効成分とを含む除草用混合物を更に含む。

【 0181 】

「光化学系 I I 阻害剤」 (b 1) は、Q_B 結合ニッチにおいて D - 1 タンパク質に結合し、それにより、葉緑体チラコイド膜における Q_A から Q_B への電子輸送をブロックする化合物である。光化学系 I I を介した受け渡しがブロックされた電子は、一連の反応を介して輸送されて毒性のある化合物を形成し、これが細胞膜を破壊して、葉緑体の膨潤、膜漏出を生じさせ、究極的には細胞破壊をもたらす。Q_B 結合ニッチは 3 つの異なる結合部

10

20

30

40

50

位を有し：結合部位Aは、アトラジンのようなトリアジン、ヘキサジノンのようなトリアジノン、およびプロマシルのようなウラシルを結合させ、結合部位Bは、ジウロンのようなフェニル尿素を結合させ、結合部位Cは、ベンタゾンのようなベンゾチアジアゾール、プロモキシニルのようなニトリル、およびピリデートのようなフェニルピリダジンを結合させる。光化学系I I 阻害剤の例としては、アメトリン、アミカルバゾン、アトラジン、ベンタゾン、プロマシル、プロモフェノキシム、プロモキシニル、クロルプロムロン、クロリダゾン、クロロトルロン、クロロクスロン、クミルロン、シアナジン、ダイムロン、デスマディファム、デスマトリーン、ジメフロン、ジメタメトリーン、ジウロン、エチジムロン、フェヌロン、フルオメツロン、ヘキサジノン、アイオキシニル、イソプロツロン、イソウロン、レナシル、リニュロン、メタミトロン、メタベンズチアズロン、メトプロムロン、メトクスロン、メトリブジン、モノリニュロン、ネブロン、ベンタノクロール、フェンメディファム、プロメトン、プロメトリーン、プロパニル、プロパジン、ピリダホル、ピリデート、シデュロン、シマジン、シメトリーン、テブチウロン、ターバシル、テルブメトン、テルブチラジン、テルブトリンおよびトリエタジンが挙げられる。

【0182】

「A H A S 阻害剤」(b2)は、アセト乳酸シンターゼ(ALS)としても公知のアセトヒドロキシ酸シンターゼ(AHAS)を阻害し、それにより、タンパク質合成および細胞成長に必要なバリン、ロイシンおよびイソロイシンのような分枝鎖脂肪族アミノ酸の產生を阻害して植物を死滅させる化合物である。A H A S 阻害剤の例としては、アミドスルフロン、アジムスルフロン、ベンスルフロン-メチル、ビスピリバク-ナトリウム、クロランスラム-メチル、クロリムロン-エチル、クロルスルフロン、シノスルフロン、シクロスルファムロン、ジクロスラム、エタメトスルフロン-メチル、エトキシスルフロン、フラザスルフロン、フロラスラム、フルカルバゾン-ナトリウム、フルメツラム、フルピルスルフロン-メチル、フルピルスルフロン-ナトリウム、ホラムスルフロン、ハロスルフロン-メチル、イマザメタベンゾ-メチル、イマザモキス、イマザピック、イマザピル、イマザキン、イマゼタビル、イマゾスルフロン、ヨードスルフロン-メチル(ナトリウム塩を含む)、イオフェンスルフロン(2-ヨード-N-[[(4-メトキシ-6-メチル-1,3,5-トリアジン-2-イル)アミノ]カルボニル]ベンゼンスルホニアミド)、メソスルフロン-メチル、メタゾスルフロン(3-クロロ-4-(5,6-ジヒドロ-5-メチル-1,4,2-ジオキサジン-3-イル)-N-[(4,6-ジメトキシ-2-ピリミジニル)アミノ]カルボニル]-1-メチル-1H-ピラゾール-5-スルホニアミド)、メトスラム、メトスルフロン-メチル、ニコスルフロン、オキサスルフロン、ペノキススラム、プリミスルフロン-メチル、プロポキシカルバゾン-ナトリウム、プロピリスルフロン(2-クロロ-N-[(4,6-ジメトキシ-2-ピリミジニル)アミノ]カルボニル]-6-プロピルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-3-スルホニアミド)、プロスルフロン、ピラゾスルフロン-エチル、ピリベンゾオキシム、ピリフタリド、ピリミノバク-メチル、ピリチオバク-ナトリウム、リムスルフロン、スルホメツロン-メチル、スルホスルフロン、チエンカルバゾン、チフェンスルフロン-メチル、トリアファモン(N-[2-[(4,6-ジメトキシ-1,3,5-トリアジン-2-イル)カルボニル]-6-フルオロフェニル]-1,1-ジフルオロ-N-メチルメタンスルホニアミド)、トリアスルフロン、トリベヌロン-メチル、トリフロキシスルフロン(ナトリウム塩を含む)、トリフルスルフロン-メチルおよびトリトスルフロンが挙げられる。

【0183】

「A C C a s e 阻害剤」(b3)は、植物における脂質および脂肪酸合成の早期段階の触媒作用を担うアセチル-C o A カルボキシラーゼ酵素を阻害する化合物である。脂質は細胞膜の必須成分であり、脂質なしで新しい細胞を生成することはできない。アセチルC o A カルボキシラーゼの阻害と、その後の脂質產生の不足によって、とりわけ、分裂組織のような活発な成長領域における細胞膜の完全性が失われることとなる。最終的に、苗条および根茎の成長が止まり、苗条分裂組織および根茎芽の枝枯れが始まる。A C C a s e

阻害剤の例としては、アロキシジム、ブトロキシジム、クレトイジム、クロジナホップ、シクロキシジム、シハロホップ、ジクロホップ、フェノキサプロップ、フルアジホップ、ハロキシホップ、ピノキサデン、プロホキシジム、プロパキザホップ、キザロホップ、セトキシジム、テプラロキシジムおよびトラルコキシジムが挙げられ、フェノキサプロップ-P、フルアジホップ-P、ハロキシホップ-Pおよびキザロホップ-Pのような分割形態、ならびにクロジナホップ-プロパルギル、シハロホップ-ブチル、ジクロホップ-メチルおよびフェノキサプロップ-P-エチルのようなエステル形態が含まれる。

【0184】

オーキシンは、多くの植物組織において成長を制御する植物ホルモンである。「オーキシン模倣体」(b4)は、植物成長ホルモンであるオーキシンを模倣し、それにより、制御されない無秩序な成長を生じさせ、感受性種における植物死を生じさせる化合物である。オーキシン模倣体の例としては、アミノシクロピラクロル(6-アミノ-5-クロロ-2-シクロプロピル-4-ピリミジンカルボン酸)とそのメチルエステルおよびエチルエステルならびにそのナトリウム塩およびカリウム塩、アミノピラリド、ベナゾリン-エチル、クロラムベン、クラシホス、クロメプロップ、クロピラリド、ジカンバ、2,4-D、2,4-DB、ジクロルプロップ、フルロキシピル、ハラウキシフェン(4-アミノ-3-クロロ-6-(4-クロロ-2-フルオロ-3-メトキシフェニル)-2-ピリジンカルボン酸)、ハラウキシフェン-メチル(メチル4-アミノ-3-クロロ-6-(4-クロロ-2-フルオロ-3-メトキシフェニル)-2-ピリジンカルボキシラート)、MCPA、MCPB、メコプロップ、ピクロラム、キンクロラック、キンメラック、2,3,6-TBA、トリクロピル、およびメチル4-アミノ-3-クロロ-6-(4-クロロ-2-フルオロ-3-メトキシフェニル)-5-フルオロ-2-ピリジンカルボキシラートが挙げられる。

【0185】

「E P S P シンターゼ阻害剤」(b5)は、チロシン、トリプトファンおよびフェニルアラニンのような芳香族アミノ酸の合成に関与する酵素である5-エノール-ピルビルシキミ酸-3-リン酸シンターゼを阻害する化合物である。E P S P 阻害剤除草剤は、植物群葉を介して容易に吸収され、師部内を成長点へと移動する。グリホサートは、この群に属する比較的非選択性の発生後処理除草剤である。グリホサートとしては、アンモニウム、イソプロピルアンモニウム、カリウム、ナトリウム(セスキナトリウムを含む)およびトリメシウム(代替名:スルホサート)などのエステルおよび塩が挙げられる。

【0186】

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

【0187】

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

10

20

30

40

50

4 - (2 - プロピン - 1 - イル) - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 6 - イル] - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン) およびチアフェナシル (メチル N - [2 - [[2 - クロロ - 5 - [3 , 6 - ジヒドロ - 3 - メチル - 2 , 6 - ジオキソ - 4 - (トリフルオロメチル) - 1 (2 H) - ピリミジニル] - 4 - フルオロフェニル] チオ] - 1 - オキソプロピル] - - アラニネート) が挙げられる。

【 0188 】

「 G S 阻害剤 」 (b 8) は、植物がアンモニアのグルタミンへの転換に用いるグルタミンシンセターゼ酵素の活性を阻害する化合物である。従って、アンモニアが蓄積し、グルタミンレベルが低下する。植物損傷は、おそらく、アンモニアの毒性と他の代謝プロセスに必要なアミノ酸の欠乏との複合効果により生じる。 G S 阻害剤としては、グルホシネートと、グルホシネート - アンモニウムおよび他のホスフィノトリシン誘導体、グルホシネート - P ((2 S) - 2 - アミノ - 4 - (ヒドロキシメチルホスフィニル) ブタン酸) およびビラナホスのようなそのエステルおよび塩が挙げられる。
10

【 0189 】

「 VLCFA エロンガーゼ阻害剤 」 (b 9) は、エロンガーゼを阻害する多種多様な化学構造を有する除草剤である。エロンガーゼは、 VLCFA の生合成に関与する、葉緑体中またはその付近に存在する酵素の 1 種である。植物中で、超長鎖脂肪酸は、葉面における乾燥を防止し、花粉粒に安定性をもたらす疎水性ポリマーの主要構成成分である。このような除草剤としては、アセトクロール、アラクロール、アニロホス、ブタクロール、カフェンストロール、ジメタクロール、ジメテナミド、ジフェナミド、フェノキサスルホン (3 - [[(2 , 5 - ジクロロ - 4 - エトキシフェニル) メチル] スルホニル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 5 , 5 - ジメチルイソオキサゾール) 、フェントラザミド、フルフェナセット、インダノファン、メフェナセット、メタザクロール、メトラクロール、ナプロアニリド、ナプロパミド、ナプロパミド - M ((2 R) - N , N - ジエチル - 2 - (1 - ナフタレニルオキシ) プロパンアミド) 、ペトキサミド、ピペロホス、プレチラクロール、プロパクロール、プロピソクロール、ピロキサスルホン、およびテニルクロールが挙げられ、 S メトラクロール、クロロアセタミドおよびオキシアセタミドのような分割形態が含まれる。
20

【 0190 】

「 オーキシン輸送阻害剤 」 (b 10) は、オーキシン担体タンパク質と結合することなどにより植物中のオーキシン輸送を阻害する化学物質である。オーキシン輸送阻害剤の例としては、ジフルフェンゾピル、ナプタラム (N - (1 - ナフチル) - フタルアミド酸および 2 - [(1 - ナフタレニルアミノ) カルボニル] 安息香酸としても公知である) が挙げられる。
30

【 0191 】

「 PDS 阻害剤 」 (b 11) は、フィトエンデサチュラーゼ工程におけるカロテノイド生合成経路を阻害する化合物である。 PDS 阻害剤の例としては、ベフルブタミド、ジフルフェニカン、フルリドン、フルロクロリドン、フルルタモンノルフルルゾンおよびピコリナフェンが挙げられる。
40

【 0192 】

「 HPPD 阻害剤 」 (b 12) は、 4 - ヒドロキシフェニル - ピルビン酸ジオキシゲナーゼの合成の生合成を阻害する化学物質である。 HPPD 阻害剤の例としては、ベンゾビシクロン、ベンゾフェナブ、ビシクロピロン (4 - ヒドロキシ - 3 - [[2 - [(2 - メトキシエトキシ) メチル] - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジニル] カルボニル] ビシクロ [3 . 2 . 1] オクタ - 3 - エン - 2 - オン) 、フェンキノトリオン (2 - [[8 - クロロ - 3 , 4 - ジヒドロ - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - オキソ - 2 - キノキサリニル] カルボニル] - 1 , 3 - シクロヘキサンジオン) 、イソキサクロルトール、イソキサフルトール、メソトリオン、ピラスルホトール、ピラゾリネート、ピラゾキシフェン、スルコトリオン、テフリルトリオン、テンボトリオン、トルピラレート (1 - [[1 - エチル - 4 - [3 - (2 - メトキシエトキシ) - 2 - メチル - 4 - (メチルスルホ
50

ニル)ベンゾイル] - 1H - ピラゾール - 5 - イル]オキシ]エチルメチルカルボネート)、トプラメゾン、5 - クロロ - 3 - [(2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル)カルボニル] - 1 - (4 - メトキシフェニル) - 2 (1H) - キノキサリノン、4 - (2, 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6 - ジメチル - 3 (2H) - ピリダジノン、4 - (4 - フルオロフェニル) - 6 - [(2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル)カルボニル] - 2 - メチル - 1, 2, 4 - トリアジン - 3, 5 (2H, 4H) - ジオン、5 - [(2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル)カルボニル] - 2 - (3 - メトキシフェニル) - 3 - (3 - メトキシプロピル) - 4 (3H) - ピリミジノン、2 - メチル - N - (4 - メチル - 1, 2, 5 - オキサジアゾール - 3 - イル) - 3 - (メチルスルフィニル) - 4 - (トリフルオロメチル)ベンズアミドおよび2 - メチル - 3 - (メチルスルホニル) - N - (1 - メチル - 1H - テトラゾール - 5 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル)ベンズアミドが挙げられる。

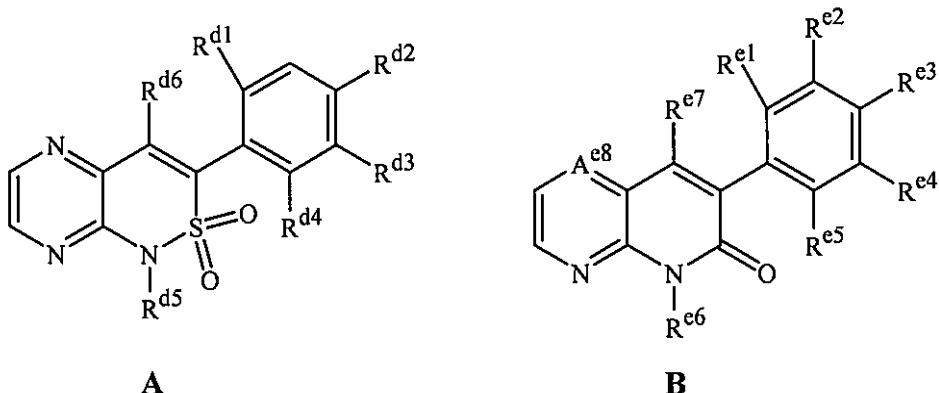
【0193】

HST阻害剤(b13)は、ホモゲンチジン酸を2 - メチル - 6 - ソラニル - 1, 4 - ベンゾキノンに変換する植物の力を攪乱し、それにより、カロテノイド生合成を攪乱する。HST阻害剤の例としては、シクロピリモレート(6 - クロロ - 3 - (2 - シクロプロピル - 6 - メチルフェノキシ) - 4 - ピリダジニル4 - モルホリンカルボキシレート)、ハロキシジン、ピリクロル、3 - (2 - クロロ - 3, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 1, 5 - ナフチリジン - 2 (1H) - オン、7 - (3, 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 5 - (2, 2 - ジフルオロエチル) - 8 - ヒドロキシピリド[2, 3 - b]ピラジン - 6 (5H) - オンおよび4 - (2, 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6 - ジメチル - 3 (2H) - ピリダジノンが挙げられる。

【0194】

HST阻害剤としては更に、式AおよびBの化合物が挙げられる。

【化15】



(式中、R^{d1}は、H、C1またはCF₃であり；R^{d2}は、H、C1またはBrであり；R^{d3}は、HまたはC1であり；R^{d4}は、H、C1またはCF₃であり；R^{d5}は、CH₃、CH₂CH₃またはCH₂CHF₂であり；R^{d6}は、OHまたは-O-C(=O)-i-Prであって；R^{e1}は、H、F、C1、CH₃またはCH₂CH₃であり；R^{e2}は、HまたはCF₃であり；R^{e3}は、H、CH₃またはCH₂CH₃であり；R^{e4}は、H、FまたはBrであり；R^{e5}は、C1、CH₃、CF₃、OCF₃またはCH₂CH₃であり；R^{e6}は、H、CH₃、CH₂CHF₂またはC1であり；R^{e7}は、OH、-O-C(=O)Et、-O-C(=O)-i-Prまたは-O-C(=O)-t-Buであり；A^{e8}は、NまたはCHである。)

【0195】

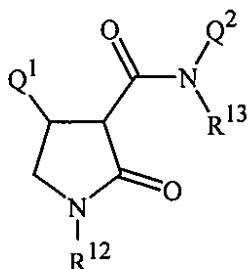
「セルロース生合成阻害剤」(b14)は、特定の植物におけるセルロースの生合成を

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

【0196】

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

【化16】



(b15A)

(式中、

R^{1-2} は、H、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキルまたはC₄~C₈シクロアルキルであり；

R^{1-3} は、H、C₁~C₆アルキルまたはC₁~C₆アルコキシであり；

Q¹は、フェニル、チエニル、ピリジニル、ベンゾジオキソリル、ナフチル、ナフタレン二ル、ベンゾフラニル、フラニル、ベンゾチオフェニルおよびピラゾリルからなる群から選択される、場合により置換されている環系であって、置換されている場合、前記環系は1~3個のR¹⁻⁴により置換されており；

Q²は、フェニル、ピリジニル、ベンゾジオキソリル、ピリジノニル、チアジアゾリル、チアゾリルおよびオキサゾリルからなる群から選択される、場合により置換されている環系であって、置換されている場合、前記環系は、1~3個のR¹⁻⁵により置換されており；

各R¹⁻⁴は、独立してハロゲン、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₃~C₈シアノアルキル、シアノ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、SF₅、NHR¹⁻⁷；または1~3個のR¹⁻⁶によって場合により置換されているフ

10

20

30

40

50

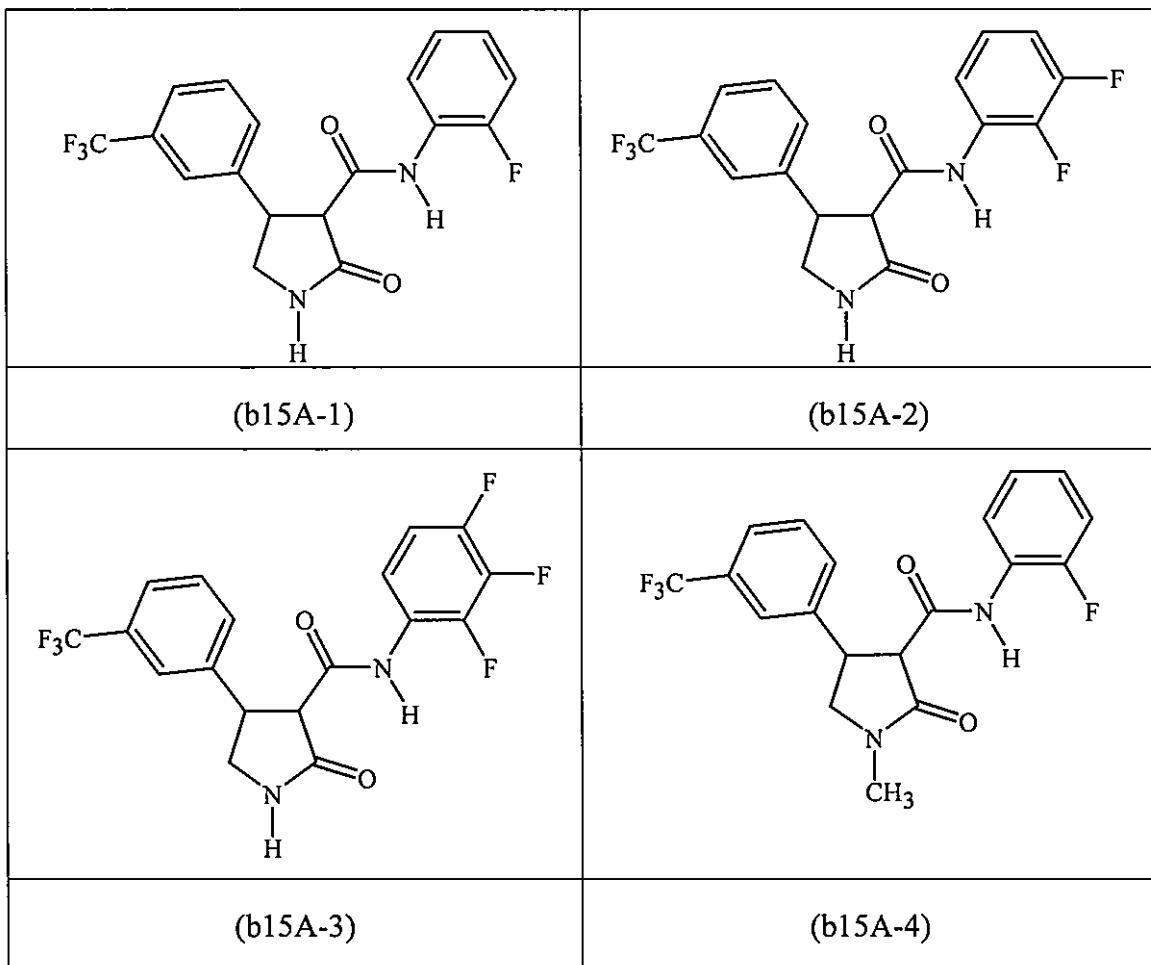
エニル；または1～3個のR^{1～6}によって場合により置換されているピラゾリルであり；各R^{1～5}は、独立してハロゲン、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、シアノ、ニトロ、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニルであり；各R^{1～6}は、独立してハロゲン、C₁～C₆アルキルまたはC₁～C₆ハロアルキルであり；R^{1～7}は、C₁～C₄アルコキカルボニルである)。

【0197】

「他の除草剤」(b15)が式(b15A)の化合物を更に含む一実施形態において、R^{1～2}は、HまたはC₁～C₆アルキルであることが好適であり；より好ましくは、R^{1～2}は、Hまたはメチルである。好ましくは、R^{1～3}は、Hである。好ましくは、Q¹は、フェニル環またはピリジニル環のいずれかであり、各環は、1～3個のR^{1～4}により置換されており；より好ましくは、Q¹は、1～2個のR^{1～4}により置換されているフェニル環である。好ましくは、Q²は、1～3個のR^{1～5}により置換されているフェニル環であり；より好ましくは、Q²は、1～2個のR^{1～5}により置換されているフェニル環である。好ましくは、各R^{1～4}は、独立してハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₃ハロアルキル、C₁～C₃アルコキシまたはC₁～C₃ハロアルコキシであり；より好ましくは、各R^{1～4}は、独立してクロロ、フルオロ、ブロモ、C₁～C₂ハロアルキル、C₁～C₂ハロアルコキシまたはC₁～C₂アルコキシである。好ましくは、各R^{1～5}は、独立してハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₁～C₃ハロアルコキシであり；より好ましくは、各R^{1～5}は、独立してクロロ、フルオロ、ブロモ、C₁～C₂ハロアルキル、C₁～C₂ハロアルコキシまたはC₁～C₂アルコキシである。「他の除草剤」(b15)として特に好適なものとしては、以下の(b15A-1)～(b15A-15)のいずれか1つが挙げられる：

【0198】

【表1】



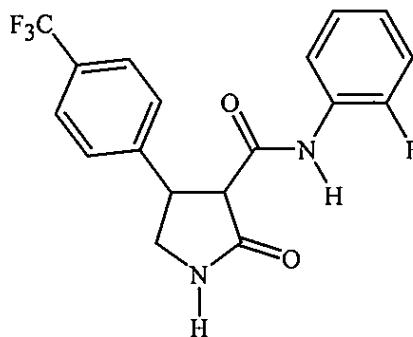
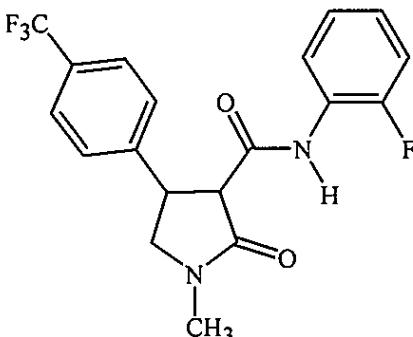
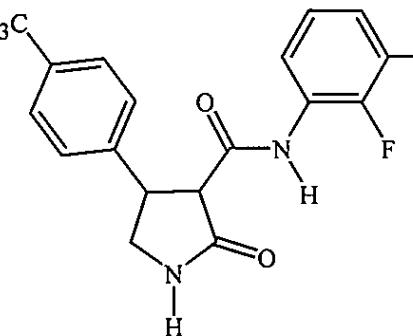
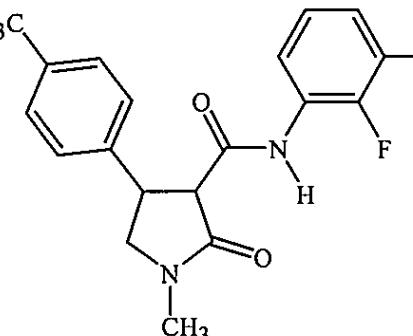
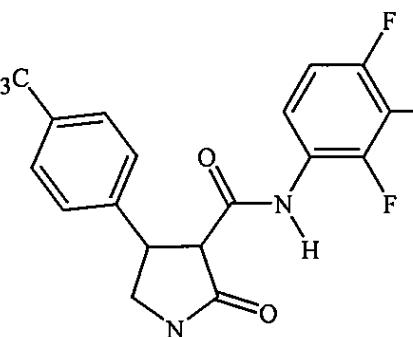
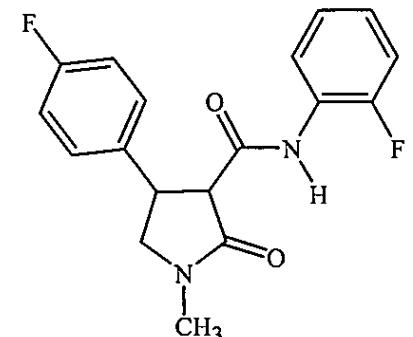
【0199】

10

20

30

【表2】

	
(b15A-5)	(b15A-6)
	
(b15A-7)	(b15A-8)
	
(b15A-9)	(b15A-10)

【0200】

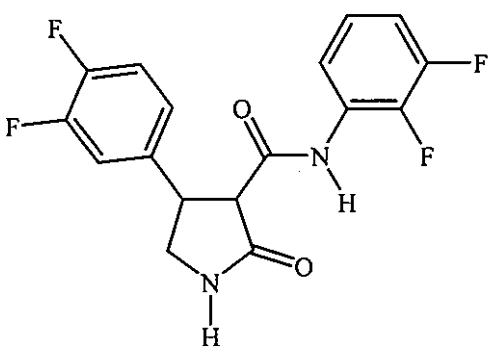
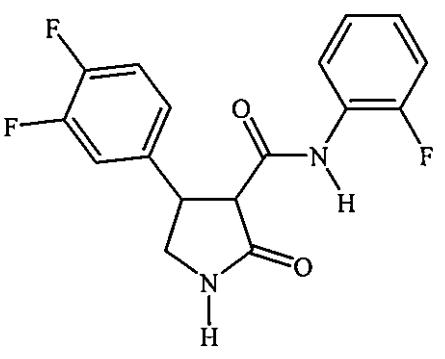
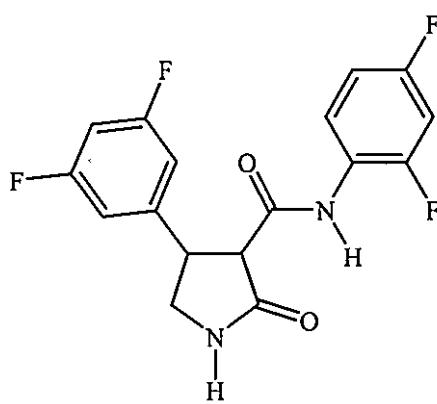
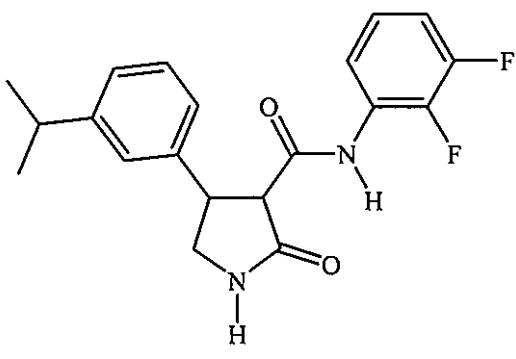
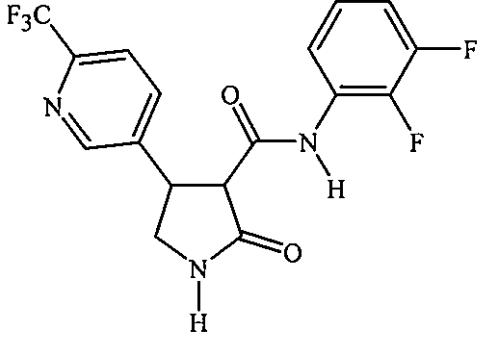
10

20

30

40

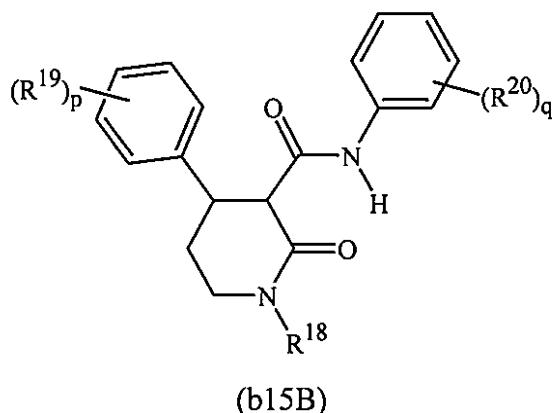
【表3】

		10
(b15A-11)	(b15A-12)	
		20
(b15A-13)	(b15A-14)	
		30
(b15A-15)		40

【0201】

「他の除草剤」(b15)は、式(b15B)の化合物を更に含む

【化17】



(式中、

$R^{1\sim 8}$ は、H、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキルまたはC₄～C₈シクロアルキルであり；

各 $R^{1\sim 9}$ は、独立してハロゲン、C₁～C₆ハロアルキルまたはC₁～C₆ハロアルコキシであり；

p は、0、1、2 または 3 の整数であり；

各 $R^{2\sim 0}$ は、独立してハロゲン、C₁～C₆ハロアルキルまたはC₁～C₆ハロアルコキシであり；

q は、0、1、2 または 3 の整数である)。

【0202】

「他の除草剤」(b15)が式(b15B)の化合物を更に含む一実施形態において、 $R^{1\sim 8}$ は、H、メチル、エチルまたはプロピルであることが好適であり；より好ましくは、 $R^{1\sim 8}$ はHまたはメチルであり；最も好ましくは、 $R^{1\sim 8}$ はHである。好ましくは、各 $R^{1\sim 9}$ は、独立してクロロ、フルオロ、C₁～C₃ハロアルキルまたはC₁～C₃ハロアルコキシであり；より好ましくは、各 $R^{1\sim 9}$ は、独立してクロロ、フルオロ、C₁フルオロアルキル(即ち、フルオロメチル、ジフルオロメチルもしくはトリフルオロメチル)またはC₁フルオロアルコキシ(即ち、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシもしくはフルオロメトキシ)である。好ましくは、各 $R^{2\sim 0}$ は、独立してクロロ、フルオロ、C₁ハロアルキルまたはC₁ハロアルコキシであり；より好ましくは、各 $R^{2\sim 0}$ は、独立してクロロ、フルオロ、C₁フルオロアルキル(即ち、フルオロメチル、ジフルオロメチルもしくはトリフルオロメチル)またはC₁フルオロアルコキシ(即ち、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシもしくはフルオロメトキシ)である。「他の除草剤」(b15)として特に好適なものとしては、以下の(b15B-1)～(b15B-19)のいずれか1つが挙げられる：

【0203】

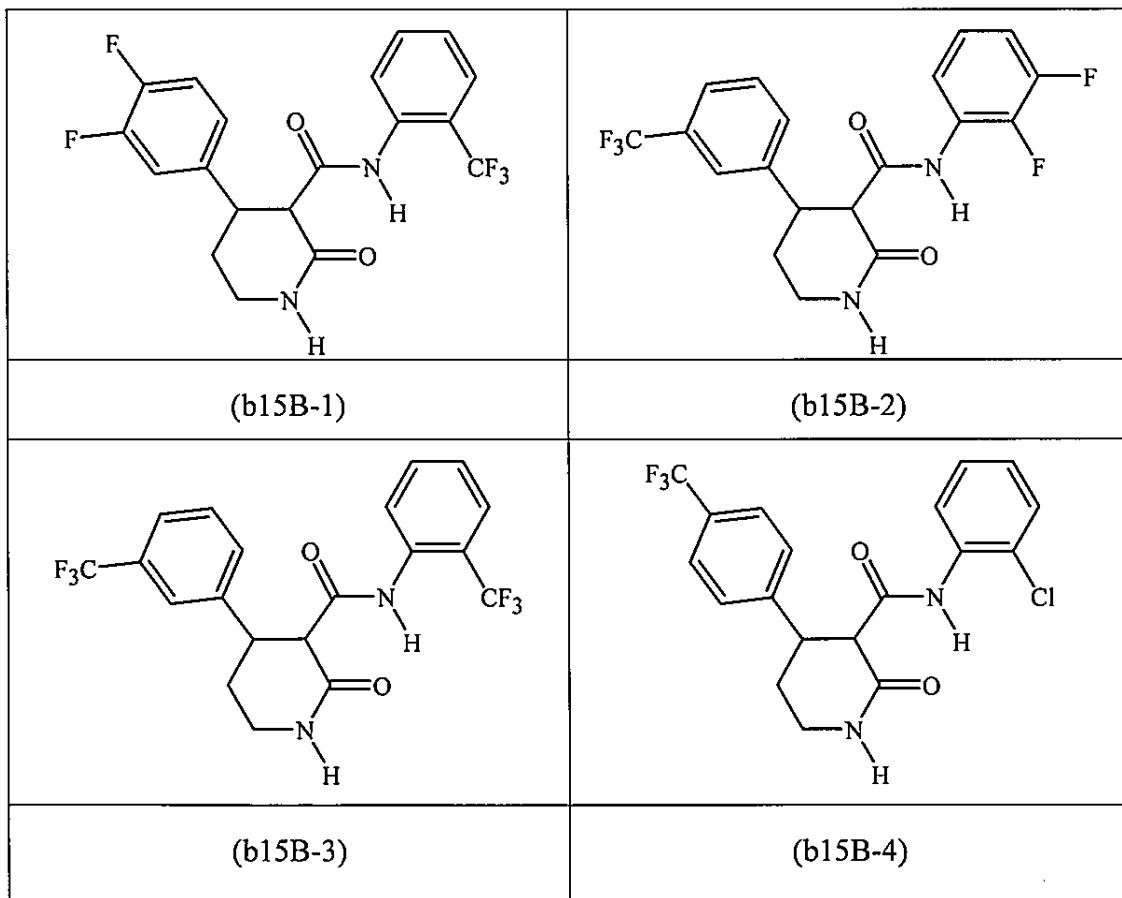
10

20

30

40

【表 4】

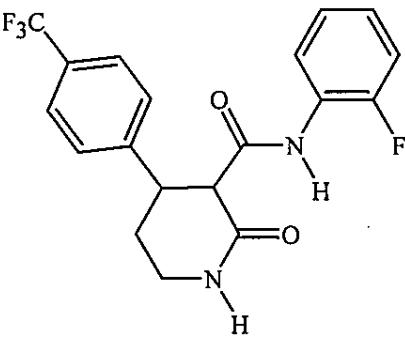
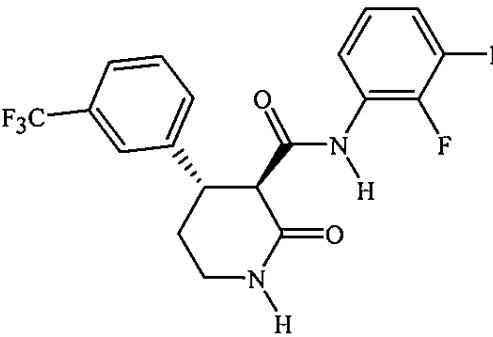
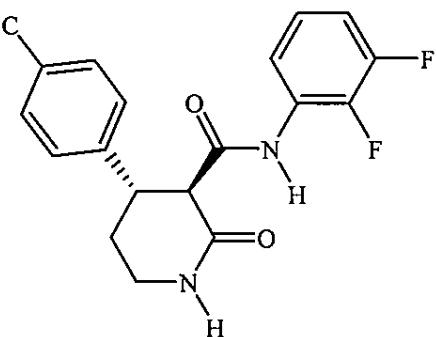
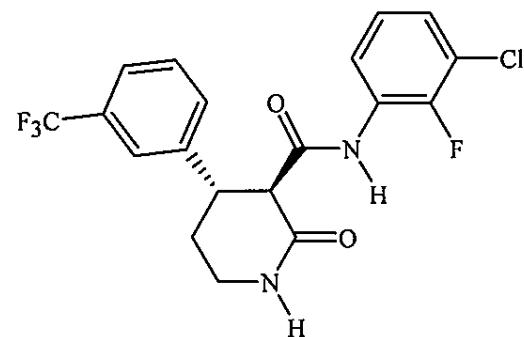
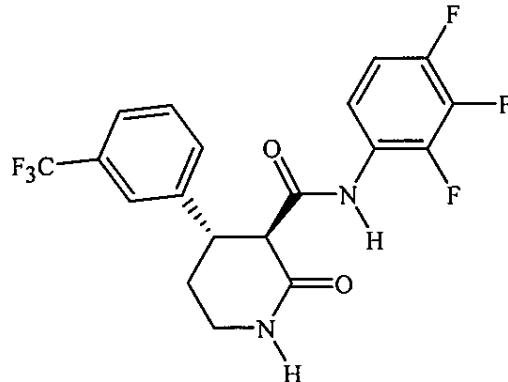
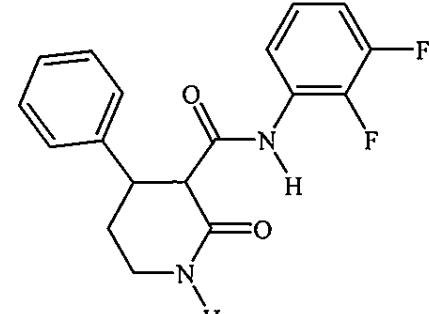


【0204】

10

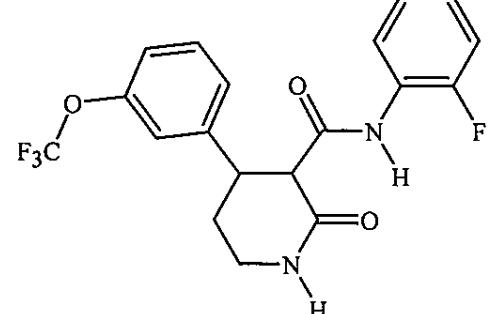
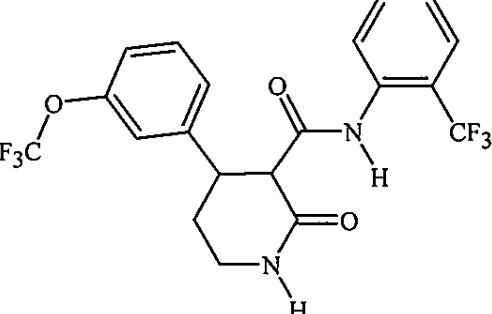
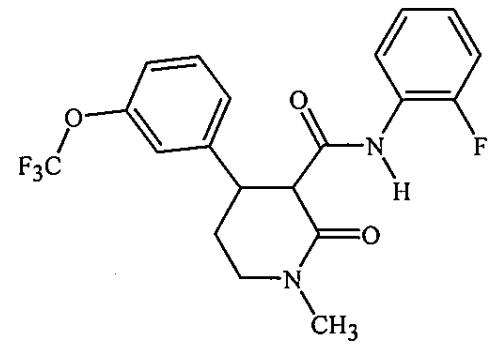
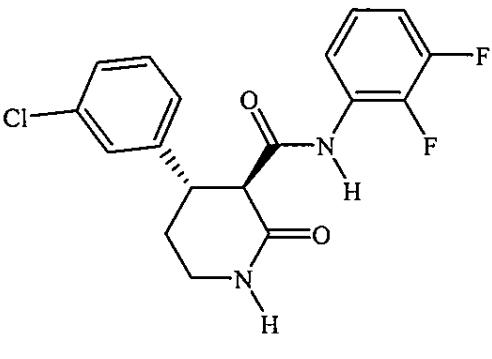
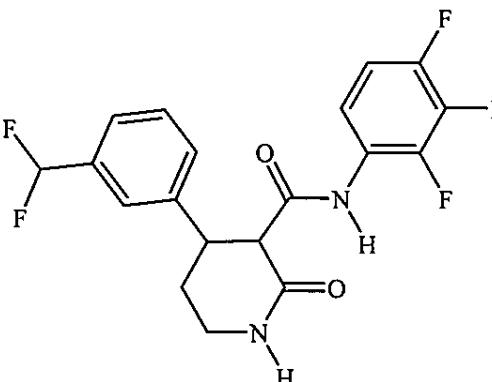
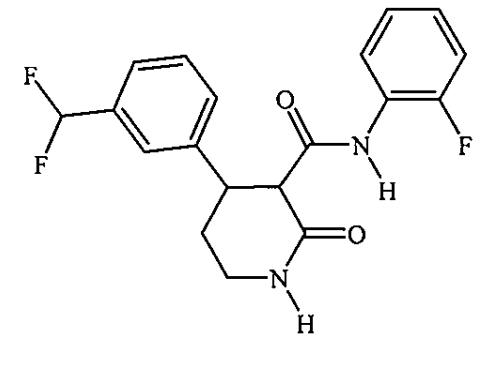
20

【表5】

		10
(b15B-5)	(b15B-6)	
		20
(b15B-7)	(b15B-8)	
		30
(b15B-9)	(b15B-10)	

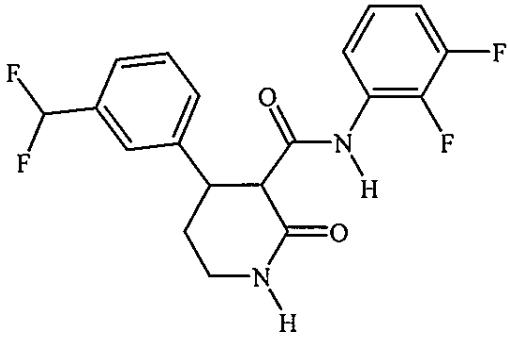
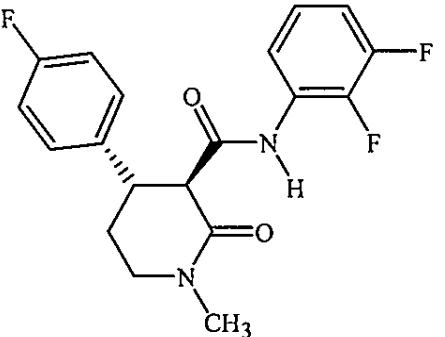
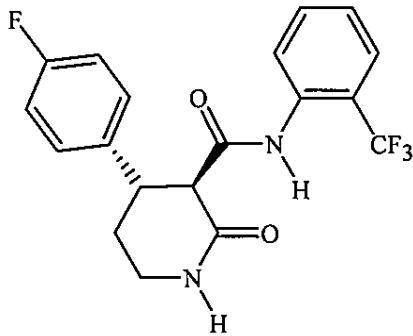
【0205】

【表 6】

		10
(b15B-11)	(b15B-12)	
		20
(b15B-13)	(b15B-14)	
		30
(b15B-15)	(b15B-16)	

【0206】

【表7】

	
(b15B-17)	(b15B-18)
	
(b15B-19)	.

【0207】

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

【0208】

スキーム1～25に記載の以下の方法およびそれらの変形の1つまたはそれ以上を用いて式1の化合物を製造することが可能である。以下の式1～42の化合物における基R¹、R²、R³、R⁴、W、XおよびGの定義は、特に断りのない限り、発明の概要において上記に定義されている通りである。式1a、1bおよび1cは、式1の化合物の部分集合であり、式1a、1bおよび1cに係る全ての置換基は、特に断りのない限り式1につ

10

20

30

40

50

いて上記で定義されている通りである。式 6 a、6 b および 6 c は、式 6 の化合物の部分集合であり、式 6 a、6 b および 6 c に係る全ての置換基は、特に断りのない限り式 6 について定義した通りである。式 3 1 a および 3 1 b は、式 3 1 の化合物の部分集合であり、式 3 1 a および 3 1 b に係る全ての置換基は、特に断りのない限り式 3 1 について定義した通りである。

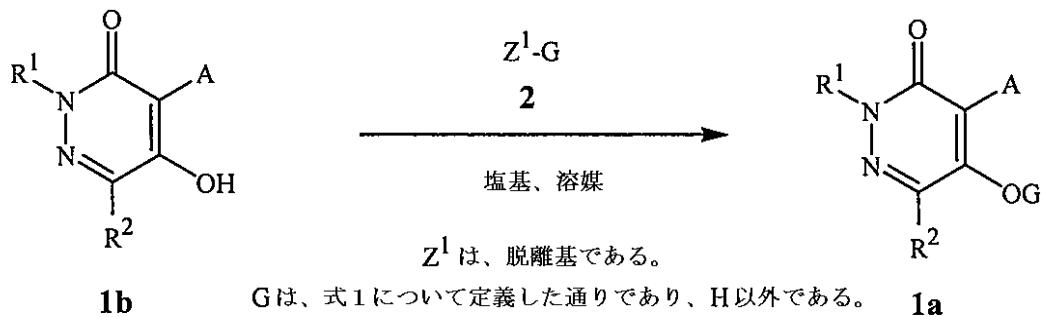
[0 2 0 9]

スキーム 1 に示すように、式 1 a のピリダジノン（W は O であり、G は上記に定義した通りであるが、水素以外である、式 1 の化合物の部分集合）は、適切な溶媒中、塩基の存在下、式 1 b の置換された 5 - ヒドロキシ - 3 (2 H) - ピリダジノン（即ち、W は、O であり、G は、H である、式 1 ）を式 2 の適切な求電子試薬（即ち、Z¹ - G、式中、Z¹ は、ハロゲンのようなヌクレオフュージ（n u c l e o f u g e ）としても知られている脱離基である）と反応させることによって製造することができる。Z¹ は C 1 である式 2 を表す試薬クラスの幾つかの例には、酸クロリド（G は - (C = O) R⁷ ）、クロロホルマート（G は - C O₂ R⁸ ）、カルバモイルクロリド（G は - C O N R⁹ R¹⁰ ）、スルホニルクロリド（G は - S (O)₂ R⁷ ）、およびクロロスルホニアミド（G は - S (O)₂ N R⁹ R¹⁰ ）が含まれる。この反応に適切な塩基の例としては、炭酸カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウムまたはカリウム t e r t - プトキシドが挙げられるが、これらに限定されず、使用される特定の塩基に応じ、適切な溶媒はプロトン性または非プロトン性とすることができます、無水で、または水性混合物として使用される。この反応に好適な溶媒としては、アセトニトリル、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、1 , 2 - ジメトキシエタン、ジオキサン、ジクロロメタン、または N , N - デミチルホルムアミドが挙げられる。反応は、一定の温度範囲下で、典型的には 0 ~ 溶媒の還流温度の範囲の温度で行うことができる。

【 0 2 1 0 】

【化 1 8】

スキーム1



【 0 2 1 1 】

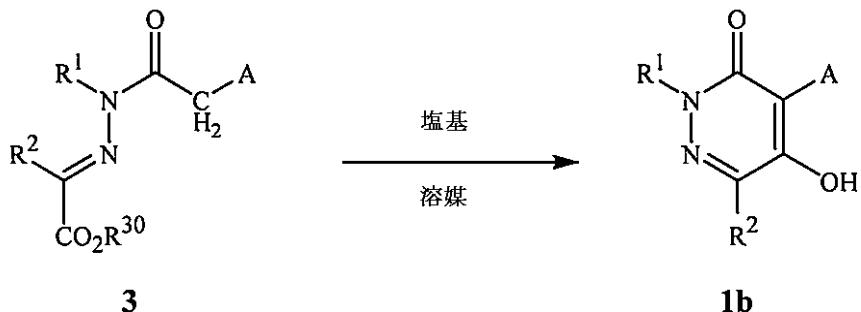
式 1 b の置換された 5 - ヒドロキシ - 3 (2 H) - ピリダジノンは、スキーム 2 に概説するように、塩基および溶媒の存在下、式 3 のヒドラジドエステル（式中、R³ 0 はアルキル、典型的にはメチルまたはエチルである）の環化によって製造することができる。この反応に適する塩基としては、炭酸カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、カリウム t - ブトキシド、または 1 , 8 - ジアザビシクロ [5 . 4 . 0] ウンデカ - 7 - エンが挙げられるが、これらに限定されない。使用される特定の塩基に応じ、適切な溶媒はプロトン性または非プロトン性とすることができます、無水で、または水性混合物として使用される。この環化のための溶媒としては、アセトニトリル、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、1 , 2 - ジメトキシエタン、ジクロロメタン、または N , N - ジメチルホルムアミドが挙げられる。この環化のための温度は一般に、0 ~ 溶媒の還流温度の範囲である。式 C H₃ (C O₂ C₂ H₅) C = N N C H₃ C (= O) C H₂ A r (式中、A r は式 3 に示す二環式環系ではなく)

、置換フェニルである)のヒドラジドエステル中間体を環化して対応する4-アリール-5-ヒドロキシ-ピリダジノンとする文献の方法が、米国特許第8,541,414号および第8,470,738号に開示されている。これらの特許に報告されているものと同じ条件が、式3のヒドラゾンエステルの式1bのピリダジノンへの環化に適用可能である。スキーム2の方法は、合成例3の工程Gに示されている。

[0 2 1 2]

【化 1 9】

スキーム2



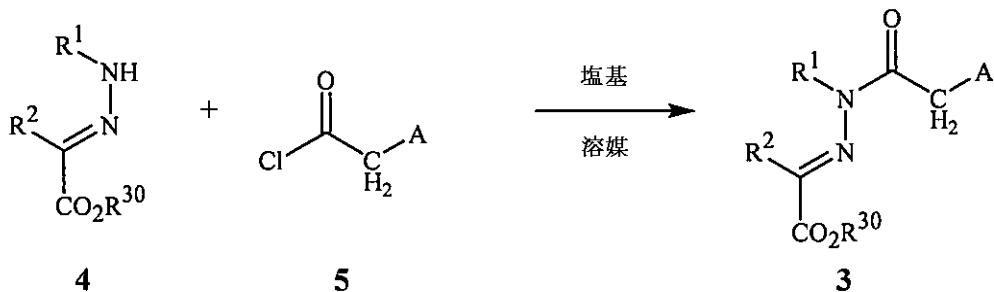
[0 2 1 3]

式3の置換ヒドラジドエステルは、スキーム3に概説するように、塩基および溶媒の存在下、式4のヒドラゾンエステル（式中、R³はアルキル、典型的にはメチルまたはエチルである）と式5の酸クロリドとのカップリングによって製造することができる。この反応に好適な塩基は通常、トリエチルアミンのような第三級アミン、またはヒューニッヒ塩基であるが、N,N-ジメチルアミノピリジン、炭酸カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、またはカリウムt-ブトキシドなどの他の塩基も使用可能である。使用される特定の塩基に応じ、適切な溶媒はプロトン性または非プロトン性とすることができる、ここで、反応は、無水条件下で、またはショッテン・パウマン条件下で水性混合物として行われる。窒素上でのこのアシル化に使用される溶媒としては、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、トルエン、1,2-ジメトキシエタン、ジクロロメタン、またはN,N-ジメチルホルムアミドが挙げられる。この反応のための温度は、0 ~ 溶媒の還流温度の範囲とすることができます。式CH₃(CO₂C₂H₅)C=NNCH₃C(=O)Ar（式中、Arは置換フェニルである）の関連するヒドラジドエステル中間体を製造する方法が特許文献に公開されており、米国特許第8,541,414号および8,470,738号、ならびに米国特許出願公開第2010/0267561号を参照されたい。これらの特許公報に開示されている手順は、スキーム3に示すように、本化合物の製造に有用な中間体の製造に直接適用可能である。

[0 2 1 4]

【化20】

スキーム3



10

【0215】

式4のヒドラゾンエステルは、エタノール、メタノール、アセトニトリルまたはジオキサンまたはジクロロメタンのような適切な溶媒中、一般に0～80の範囲の温度で、式 R^1NHNNH_2 の適切に置換されたヒドラジンと式 $\text{R}^2(\text{C}=\text{O})\text{CO}_2\text{R}^{30}$ （式中、 R^{30} は典型的にはメチルまたはエチル）のケトンまたはアルデヒドエステルとを反応させることによって容易に入手することができる。米国特許出願公開第2007/01112038号および第2005/0256123号は、メチルヒドラジンおよびケトエステル $\text{CH}_3(\text{C}=\text{O})\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$ からこのヒドラゾンを形成する手順を開示する。

20

【0216】

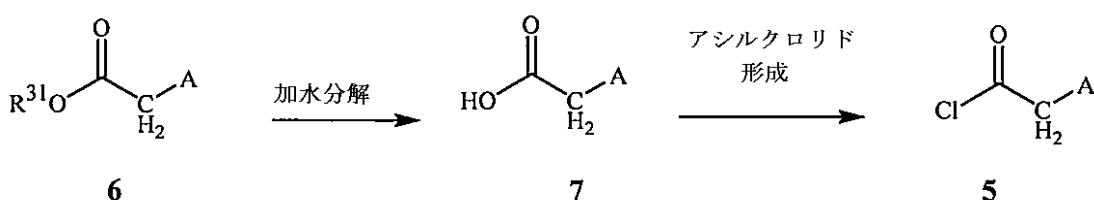
スキーム4に示すように、式5の二環式アセチルクロリドは、 R^{31} は典型的にはメチルまたはエチルである式6の対応する二環式酢酸エステルから、エステル加水分解および酸クロリド形成によって製造することができる。この変換のための標準的な方法は、文献において公知である。例えば、エステル加水分解は、式6のエステルのアルコール溶液をアルカリ金属水酸化物の水溶液と共に加熱し、続いて鉛酸で酸性化することにより達成可能である。次いで、形成された式7のカルボン酸を、ジクロロメタンのような不活性溶媒中、オキサリルクロリドと触媒量のN,N-ジメチルホルムアミドで処理することにより、式5の対応するアシリルクロリドに変換することができる。J. Heterocyclic Chem. 1983, 20(6), 1697～1703; J. Med. Chem. 2007, 50(1), 40～64; ならびにPCT特許公報WO2005/012291、WO98/49141およびWO98/49158は、ベンゾフラン-およびベンゾチオフェン-酢酸エステルの対応する酢酸への加水分解を開示している。Monatshefte für Chemie 1968, 99(2) 715～720、ならびに特許公報WO2004046122、WO2009/038974およびJP09077767は、ベンゾフラン-およびベンゾチオフェン-酢酸の対応する酸クロリドへの変換を開示している。スキーム4の加水分解工程は、合成例3の工程Dに示されている。

30

【0217】

【化21】

スキーム4



40

【0218】

スキーム5に示すように、式6aのビシクロフランアセタート（即ち、Y⁴はOである式6）は、テトラヒドロフランまたはトルエンのような不活性溶媒中、 R^{31} は典型的に

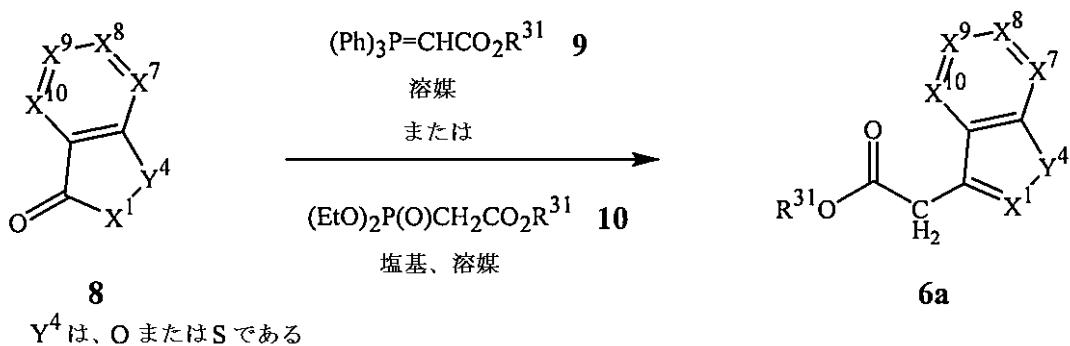
50

はメチルまたはエチルである式 9 の (トリフェニルホスホラニリジン) アセタートとのウイッティヒ反応により、または、一般には無水テトラヒドロフランまたはジオキサンである適切な溶媒中、水素化ナトリウムまたはカリウム t e r t - プトキシドのような塩基の存在下、R³¹ は典型的にはメチルまたはエチルである式 10 のホスホナートアセタートを使用したワズワース・エモンズ反応によって、式 8 の二環式フラン - 3 - オン（式中、A は A - 4 である）から製造することができる。この反応は、最初に形成される環外二重結合（ジヒドロベンゾフラン置換不飽和エステルの形成）の二環式フラン環系内部への移動を伴うことにより、式 6 a の二環式フランアセタートを生成する。ウイッティヒ変換のための例示的な条件は、PCT 特許公報 WO 2008 / 074752 に記載されている。温度は、典型的には 0 ~ 溶媒の還流温度の範囲である。場合によっては、エステルと共に役した環外二重結合を完全二環式フラン環系内の環内位置に移動させるために、より長時間の加熱が必要である。スキーム 5 の方法は、合成例 3 の工程 B に示されている。

【 0 2 1 9 】

【化 2 2】

スキーム5



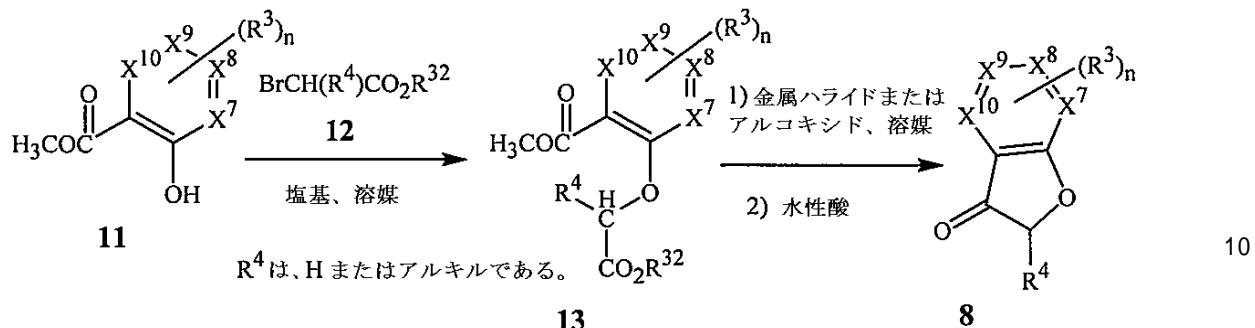
【 0 2 2 0 】

スキーム 6 に示すように、R⁴ は水素またはアルキルである式 8 (式中、A は、A-4 である) の置換された二環式フラン-3-オンまたは二環式チオフェン-3-オンは、第一に、適切な溶媒、例えば、アセトニトリル、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、ジオキサンまたはN,N-ジメチルホルムアミド中、炭酸カリウムまたは水素化ナトリウムのような塩基の存在下、0~溶媒の還流温度の範囲の温度で、式 11 のサリチラートを式 12 の - プロモエステル (式中、R³² は、典型的にはメチルまたはエチルである) でアルキル化することによって製造することができる。次に、テトラヒドロフラン、ジオキサン、1,2-ジメトキシエタンまたはN,N-ジメチルホルムアミドのような不活性溶媒中、式 13 のビスエステルを金属ハライドまたはアルコキシド、例えば、水素化ナトリウムまたはカリウムtert-ブトキシドで処理して式 8 の対応する二環式フラン-3-オンを形成する。式 13 のジエステルを式 8 の二環式フラン-3-オンに変換する代替的なより段階的な方法が、PCT 特許公報WO 2008/074752 に報告されているが、スキーム 5 の方法は、簡便な一工程で式 8 の二環式フラン-3-オンを提供するための式 13 のジエステルの環化とそれに続くエステル加水分解および脱炭酸を可能にする。

【 0 2 2 1 】

【化 2 3】

スキーム 6



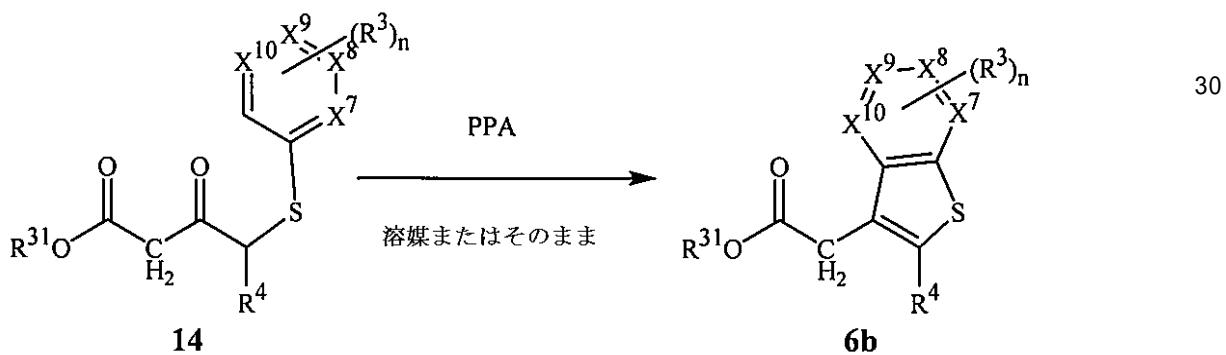
【 0 2 2 2 】

スキーム 7 に図示するように、R⁴ は水素またはアルキルである式 6 b の置換された二環式チオフェン（即ち、X は S である式 6）は、式 1 4 の適切に置換されたフェニルチオケトエステルを、一般には、酸性条件下、好ましくはポリリン酸（PPA）をそのまま、または不活性な概して高沸点の溶媒、例えば、クロロベンゼン、キシレンまたはトルエン中で用いて環化することによって、容易に入手可能である。クロロベンゼンが好適な溶媒である。クロロベンゼン中で PPA を使用するこの環化の文献例については、J. Heterocyclic Chem. 1988, 25, 1271~1272 を参照されたい。更に、この PPA 媒介環化を用いてベンゾチオフェンアセタートを製造するための公表された実験の詳細については、米国特許第 5 376 677 号を参照されたい。

【 0 2 2 3 】

【化 2 4】

スキーム7



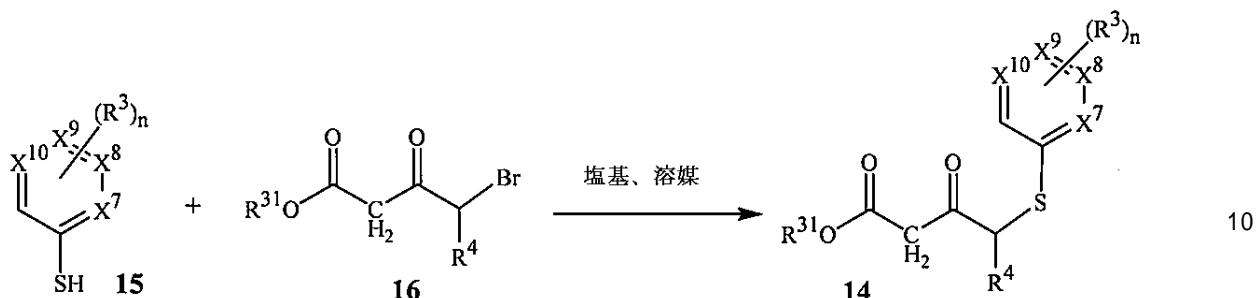
【 0 2 2 4 】

スキーム 8 に示すように、J. Heterocyclic Chem. 1988, 25、1271~1272 および米国特許第 5376677 号においても教示されている方法により、溶媒中、塩基の存在下、式 16 の $4\text{-Br}-1,3\text{-O}_2\text{CCH}_2\text{CO}_2\text{R}$ 、式中、R は、一般にメチルまたはエチルである) で式 15 のチオ複素環をアルキル化することによって、式 14 の置換された $4\text{-Ar}-1,3\text{-O}_2\text{CCH}_2\text{CO}_2\text{R}$ を容易に製造することができる。アセトニトリルまたは N, N-ジメチルホルムアミドのような極性非プロトン性の溶媒中、アルカリまたは炭酸カリウムのようなアルカリ炭酸塩でのアルキル化が一般に好適である。

【 0 2 2 5 】

【化25】

スキーム8



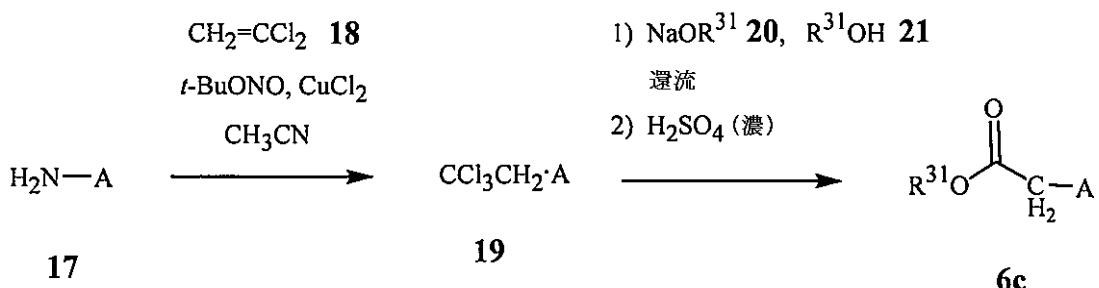
【0226】

スキーム9に示すように、式6cのヘテロアリール酢酸誘導体（即ち、Xは-C(R⁶)=C(R⁷)-である式6）は、式17の適切に置換されたヘテロアリールアミンから製造することができる。この方法によれば、1,1-ジクロロエテン（18）の存在下、式17のアミンがジアゾ化（好ましくは、アセトニトリル中塩化第二銅の存在下、亜硝酸t-ブチルで）され、式19の対応するトリクロロエチル複素環を得られる。次いで、式21のアルコールのような適切な溶媒中、式19のトリクロロエチル複素環を式20のナトリウムアルコキシドのような適切なアルカリまたはアルカリ土類アルコキシドと共に加熱し、続いて濃硫酸などを用いて酸性化して式6cの複素環式酢酸エステルを得る。この方法は、Pest. Manag. Sci. 2011, 67, 1499~1521、および米国特許第5376677号に教示されている。

【0227】

【化26】

スキーム9



【0228】

式6cのヘテロアリール酢酸エステルを製造する代替的な方法を、スキーム10に概説する。Pest. Manag. Sci. 2011, 67, 1499~1521に記載の方法に教示されるように、式22のメチル複素環を、ジクロロメタン、ジクロロエタン、またはテトラクロロメタンのような不活性溶媒中、フリーラジカル条件（例えば、触媒としての過酸化ベンゾイル）下、N-プロモモハク酸イミド（NBS）で臭素化して式23のヘテロアリールメチルプロミドを得ることができる。式23の化合物をアルカリまたはアルカリシアン化物（例えば、シアノ化カリウム）と反応させることによって臭素をシアノ化物で置き換えると、式24のヘテロアリールアセトニトリルが得られ、これを酸性アルコール（例えば、メタノールまたはエタノール中のHCl）中、一般に溶媒の還流温度で加熱することにより、加水分解して式6cの酢酸エステルへエステル化することができる。アルコールR³¹OHは、低級アルカノールである。

【0229】

10

20

30

40

50

【化27】

スキーム10



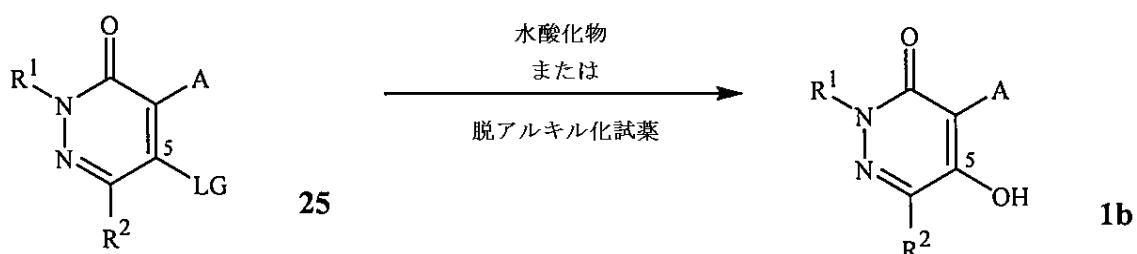
【0230】

ピリダジノン環の5位の脱離基の加水分解を、スキーム11に示すように達成することができる。LG基が低級アルコキシ、低級アルキルスルフィド（スルホキシドまたはスルホン）、ハライド、またはN-結合アゾールである場合、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、またはジオキサンのような溶媒中、0~120の温度での水酸化テトラブチルアンモニウムのような塩基性試薬による加水分解によって除去することができる。この加水分解に有用な他の水酸化物試薬としては、水酸化カリウム、水酸化リチウムおよび水酸化ナトリウムが挙げられる（例えば、WO 2009/086041を参照されたい）。LG基が低級アルコキシである場合、LG基の加水分解は、三臭化ホウ素またはモルホリンのような脱アルキル化試薬を用いて達成することもできる（例えば、WO 2009/086041、WO 2013/160126およびWO 2013/050421を参照されたい）。

【0231】

【化28】

スキーム11



【0232】

ピリダジノンの6位におけるハロゲンの導入は、亜鉛化（zincation）とそれに続くハロゲン化によって達成可能である。ピリダジノンの亜鉛化の条件、試薬、および例については、Verhelst, T.、Ph.D. thesis, University of Antwerp, 2012を参照されたい。典型的には、式26のピリダジノンを、テトラヒドロフラン中、-20~30で、Zn(TMP)-LiClまたはZn(TMP)₂-MgCl₂-LiCl（即ち、トルエン/テトラヒドロフラン中の2,2,6,6-ビス（テトラメチルピペリジン）亜鉛、塩化マグネシウム、塩化リチウム複合体）の溶液で処理して亜鉛試薬を形成する。その後の臭素、N-プロモコハク酸イミドまたはヨウ素の添加により、式27の化合物（式中、R²は、それぞれBrまたはIである）が得られる。トリクロロイソシアヌル酸または1,3-ジクロロ-5,5-ジメチルヒダントインのような試薬が、式27の化合物（式中、R²は、Clである）を生成する。この方法をスキーム12に示す。種々の適切な亜鉛化試薬の製造については、Wunder

40

40

50

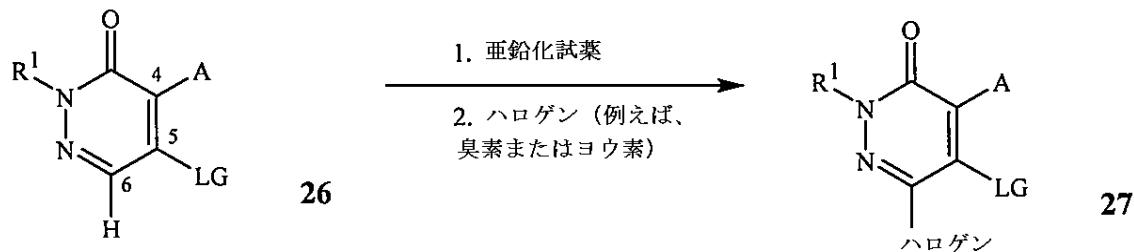
lich, S. Ph.D. thesis, University of Munich, 2010およびこれに引用されている参考文献、ならびにWO 2008/138946およびWO 2010/092096を参照されたい。ピリダジノン環の6位における亜鉛化は、ピリダジノン環の4位に芳香族/ヘテロ芳香族置換基、アルコキシ置換基もしくはハロゲンが存在する場合、またはピリダジノン環の5位にハロゲンまたはアルコキシ置換基が存在する場合に達成可能である。

【0233】

【化29】

スキーム 12

10



【0234】

式28(式中、R²はハロゲンまたはスルホナートである)の化合物のR²置換基は更に、他の官能基に変換可能である。R²がアルキル、シクロアルキルまたは置換アルキルである化合物は、スキーム13に示すように、式28の化合物の遷移金属触媒反応によって製造可能である。これらのタイプの反応の総説については、以下を参照されたい：E. Negishi, Handbook of Organopalladium Chemistry for Organic Synthesis, John Wiley and Sons, Inc., New York, 2002, N. Miyaura, Cross-Coupling reactions: A Practical Guide, Springer, New York, 2002, H. C. Brownら, Organic Synthesis via Boranes, Aldrich Chemical Co., Milwaukee, Vol. 3, 2002, Suzukiら, Chemical Reviews 1995, 95, 2457~2483 および Molanderら, Accounts of Chemical Research 2007, 40, 275~286。更に、Tetrahedron Organic Chemistry Series Vol. 26: Palladium in Heterocyclic Chemistry、第2版、GribbleおよびLi編、Elsevier、Amsterdam, 2007を参照されたい。ブッファルト・ハートウィッグ化学の概説については、YudinおよびHartwig, Catalyzed Carbon-Heteroatom Bond Formation, 2010, Wiley, New Yorkを参照されたい。

【0235】

20

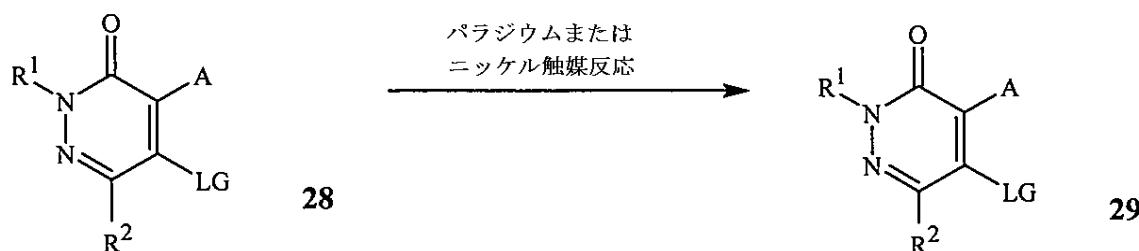
30

30

40

【化30】

スキーム 13



R^2 は、ハロゲンまたはスルホナートである

R^2 は、アルキル、シクロアルキル、
置換アルキルである

【0236】

式30aの R^2 位に他の官能基を導入するための関連する合成方法は、当技術分野で公知である。CF₃基の導入には、銅触媒反応が有用である。この反応のための試薬の最近の包括的概説については、Wu, NeumannおよびBeilier, Chemistry: An Asian Journal, 2012, ASAP、およびこれに引用されている参考文献を参照されたい。この位置における硫黄含有置換基の導入については、WO 2013/160126に開示された方法を参照されたい。シアノ基の導入については、WO 2014/031971を参照されたい。ニトロ基の導入については、J. Am. Chem. Soc., 2009, 128, 98を参照されたい。フルオロ置換基の導入については、J. Am. Chem. Soc., 2014, 3792を参照されたい。

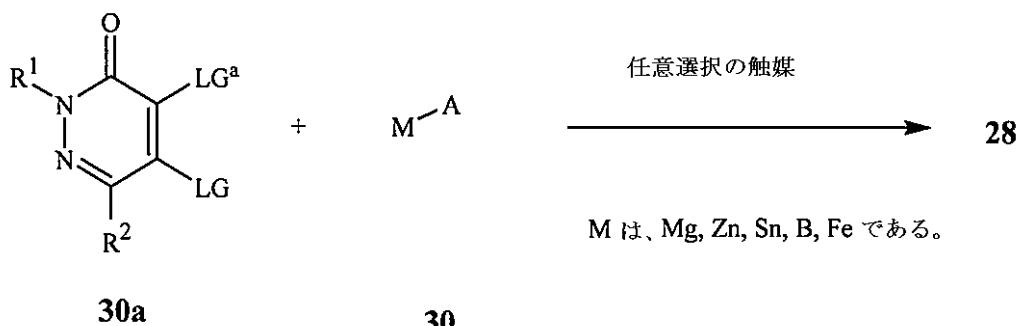
【0237】

式28の化合物は、スキーム14に示すように、式30の有機金属試薬と4位に反応基を有する式30aのピリダジノンとの反応によって製造可能である。脱離基によっては、遷移金属触媒が望ましい場合がある。脱離基が低級アルコキシ、N-結合アゾール（ピラゾールまたはトリアゾールのような）、またはスルホナートである場合、触媒は不要であり、マグネシウム試薬またはリチウム試薬との直接的な反応が4位において起こり得る。この反応は、有機マグネシウム試薬と反応しない種々の溶媒中で行うことができる。典型的な反応条件は、溶媒としてのテトラヒドロフラン、-20～65の反応温度、および過剰量の有機マグネシウムまたは有機リチウム試薬を含む。4位の反応基がハロゲンである場合、遷移金属触媒およびリガンドが有用である。ホウ素（鈴木反応）、スズ（ステイル反応）、および亜鉛（根岸反応）を含む、種々の異なるカップリングパートナーを使用可能である；これらの反応は、多種多様なリガンドを有するパラジウムおよびニッケル触媒による触媒作用を受けることができる。これらの反応のための条件は、当技術分野で公知である；例えば、Palladium-Catalyzed Coupling Reactions: Practical Aspects and Future Development Edited by Arpad Molnar, Wiley, 2013、およびこれに引用されている参考文献を参照されたい。非触媒法で使用される有機マグネシウム試薬は、マグネシウムを炭素-ハロゲン結合に直接挿入（場合によりハロゲン化リチウムの存在下で）することにより、i-プロピルマグネシウムハライドとのグリニヤール交換反応（場合によりハロゲン化リチウムの存在下で）により、または臭化マグネシウムエーテラートのようなマグネシウム塩との反応による有機リチウム試薬の変換により製造可能である。有機マグネシウム試薬に対して不活性な種々の基が、これらの反応においてピリダジノンの R^2 および5位に存在可能である。式30の化合物は、Knoc helら、Angew. 2011, 50, 9794～9824、およびHeterocycles 2014, 88, 827～844に見出される方法に従って製造可能である。

【0238】

【化31】

スキーム14



【0239】

式30aの化合物は、当技術分野で公知であるか、MaessおよびLemiere、Comprehensive Heterocyclic Chemistry III Volume 8、Katritsky, Ramsden, ScriverおよびTaylor編、ならびにこれに引用されている参考文献に記載された方法によって製造可能である。更に、Verhelst, Ph.D. thesis University of Antwerp、およびこれに引用されている参考文献を参照されたい。ピリダジノン上における官能基変換は、Stevensonら、J. Heterocyclic Chem. 2005, 42, 427; 米国特許第6,077,953号; WO 2009/086041およびこれに引用されている参考文献; 米国特許第2,782,195号; WO 2013/160126; ならびにWO 2013/050421にも記載されている。

【0240】

式1bの化合物は、水性塩基中での式31のスルホンの加水分解によっても製造可能である。適する塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、または水酸化テトラブチルアンモニウムが挙げられる。典型的な反応温度は、0~80 の範囲であり、典型的な反応時間は1~12時間である。この方法をスキーム15に示す。

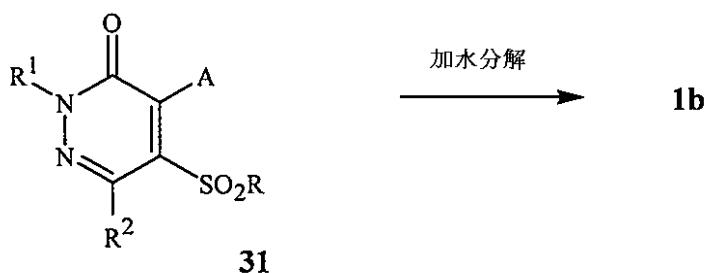
【0241】

【化32】

20

30

スキーム15



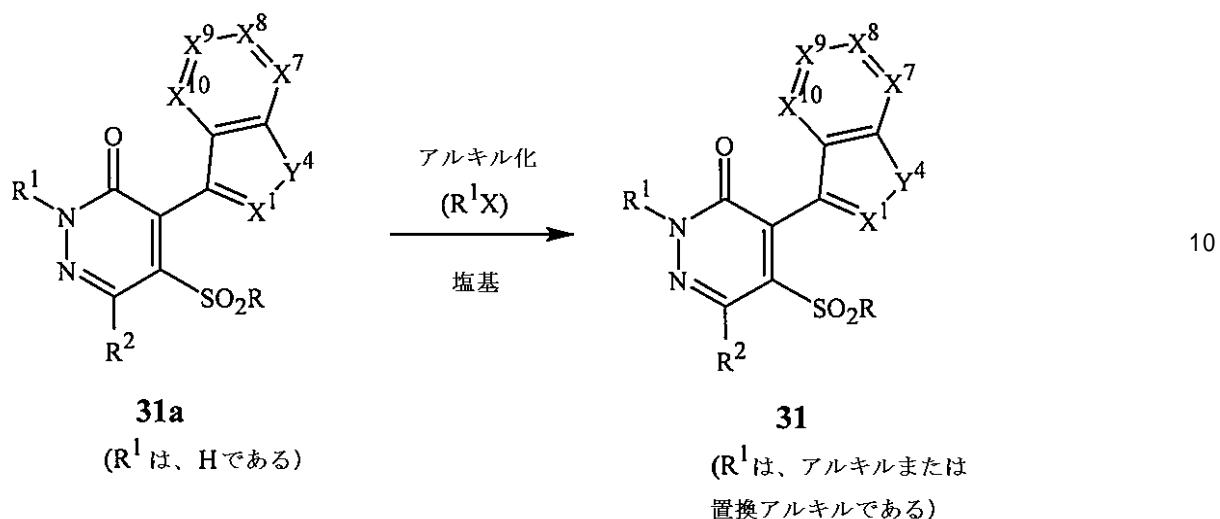
【0242】

式31の化合物は、R¹はHである式31aの化合物をハロゲン化アルキルおよびスルホナートでアルキル化することによって製造可能である。この方法に有用な典型的な塩基としては、炭酸カリウム、炭酸ナトリウムまたは炭酸セシウムが挙げられる。典型的な溶媒としては、スキーム16に示すように、アセトニトリル、テトラヒドロフランまたはN,N-ジメチルホルムアミドが挙げられる。

【0243】

【化33】

スキーム16



【0244】

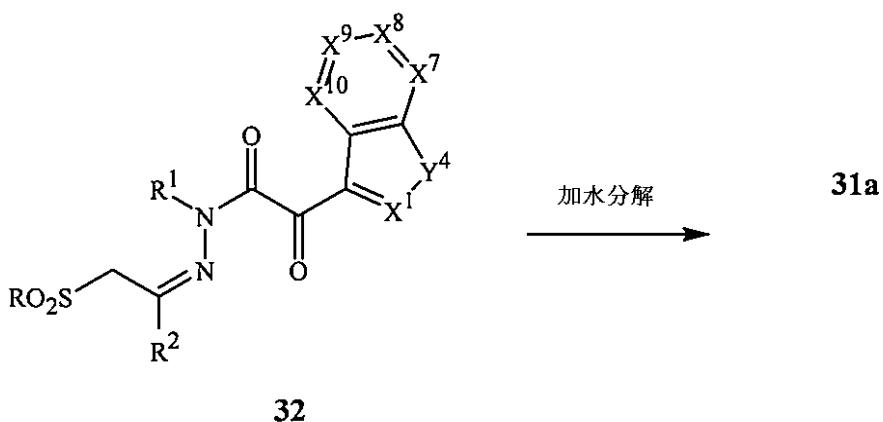
式31aの化合物は、塩基での処理による式32の化合物の環化によって製造可能である。この方法に有用な典型的な塩基としては、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、または炭酸セシウムが挙げられる。典型的な溶媒としては、スキーム17に示すように、アセトニトリル、テトラヒドロフランまたはN,N-ジメチルホルムアミドが挙げられる。

20

【0245】

【化34】

スキーム17



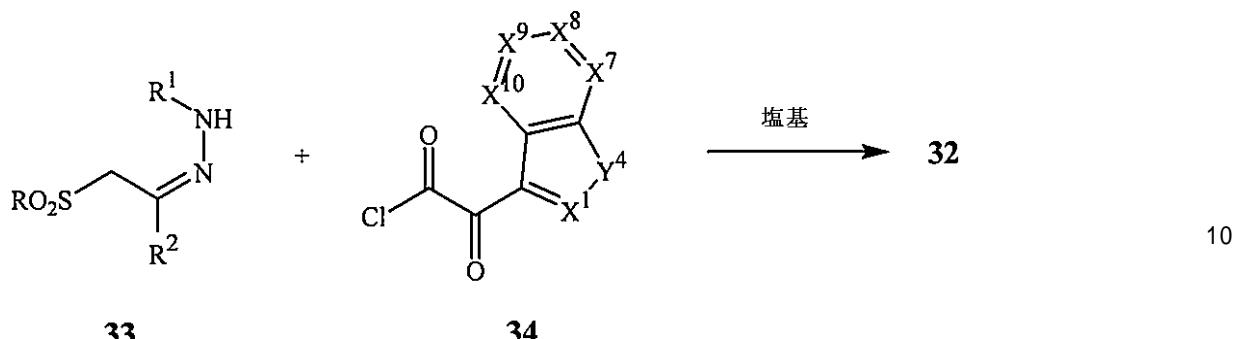
【0246】

40

式32の化合物は、スキーム18に示す方法によって製造可能である。この方法において、式33の化合物は、塩基の存在下で式34の化合物とカップリングされる。この方法に有用な塩基としては、トリエチルアミン、炭酸ナトリウムもしくは炭酸カリウム、ビリジン、またはジイソプロピルエチルアミンが挙げられる。

【0247】

【化35】

スキーム18

【0248】

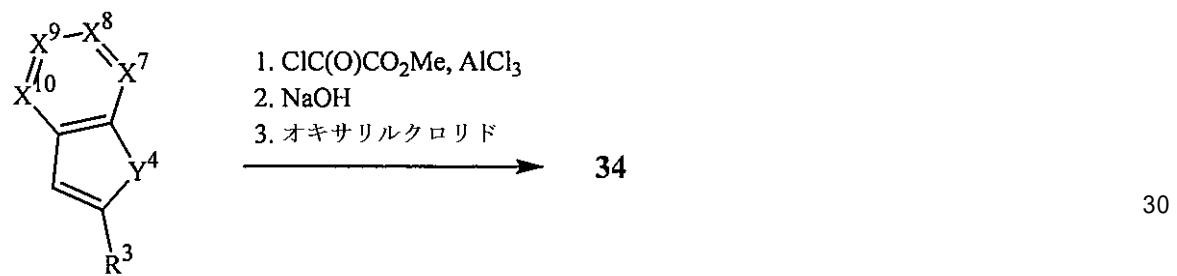
式33の化合物は、当技術分野で公知の方法によって製造可能である。

【0249】

式34の化合物は、幾つかの方法によって製造可能である。スキーム19に示す一方法においては、三塩化アルミニウムの存在下で式35の化合物をまず $\text{ClC(O)CO}_2\text{Me}$ で処理する。その後のカルボン酸への加水分解とそれに続くオキサリルクロリドでの処理により、式34のアシリルクロリドが得られる。

【0250】

【化36】

スキーム19

【0251】

式35の化合物は、市販されているか、当技術分野で公知の方法によって製造可能である。

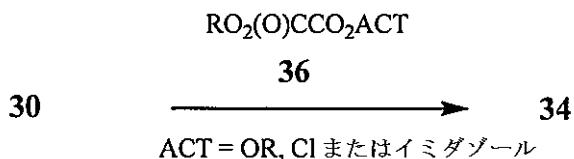
【0252】

式34の化合物は、ヘテロ芳香族有機金属試薬と式36の活性シュウ酸エステルとの反応によっても製造可能である。活性化基は、アルキルエ斯特ル、ハロゲン、またはイミダゾールとすることができます。金属は、リチウムまたはマグネシウムとすることができます。パラジウム触媒を利用する場合は、亜鉛およびスズのような他の金属基を使用してもよい。

【0253】

40

【化37】

スキーム20

【0254】

10

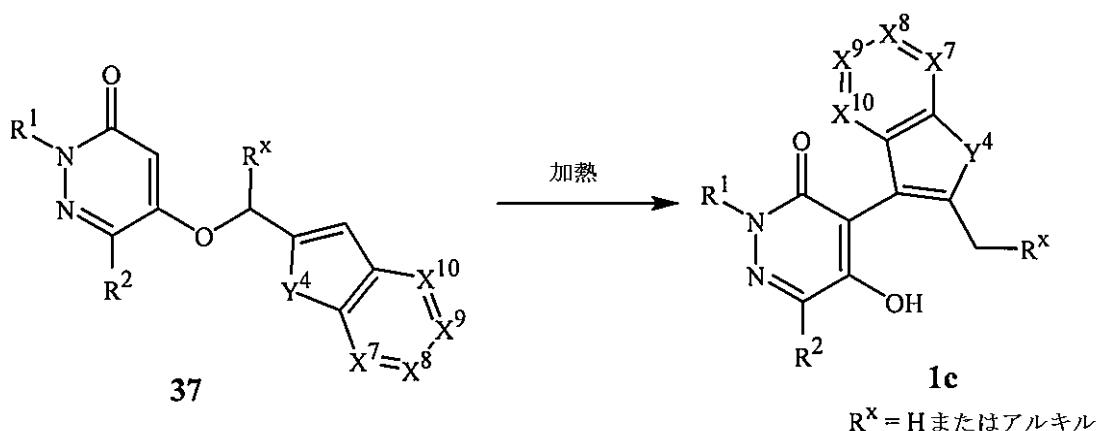
スキーム21に示すように、式1cの化合物は、式37の化合物の転位によって製造可能である。この転位は、110と300の間の温度で実行可能である。適する溶媒としては、キシレン、ジエチルベンゼン、およびメシチレンのような芳香族炭化水素、ならびにジクロロベンゼンのようなハロゲン化芳香族化合物が挙げられるが、これらに限定されない。Dowtherm Aおよびジグリムのような他の高沸点溶媒を採用することも好都合である。特に、イオン性液体を媒体に添加する場合は、沸点がより低い他の多くの溶媒をマイクロ波加熱と併用することができる。

【0255】

【化38】

スキーム21

20



30

【0256】

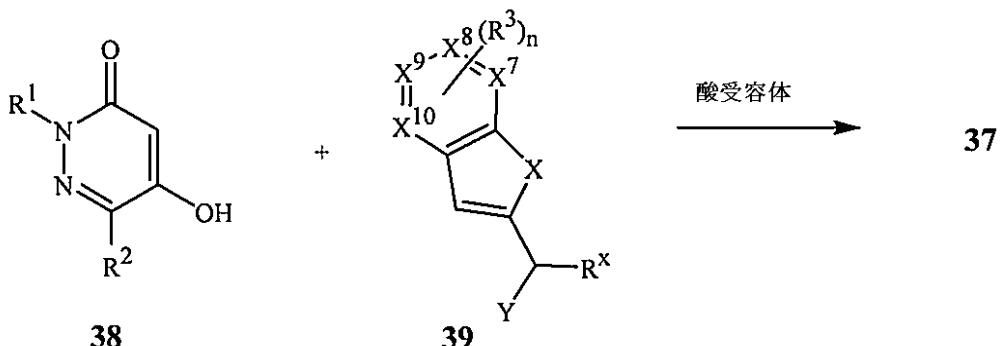
40

式37の化合物は、スキーム22に示すように、式38のピリダジノンを式39のハロゲン化アルキルでアルキル化することにより製造可能である。反応は、アセトン、2-ブタノン、アセトニトリル、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリジノン、ジメチルスルホキシド、およびジメチルホルムアミドのような種々の溶媒中で実施できる。限定されるものではないが、炭酸セシウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、水酸化カリウム、または水酸化ナトリウムのような酸受容体の存在が好適である。脱離基Yは、ハロゲンまたはスルホナートとすることができます。

【0257】

【化39】

スキーム22



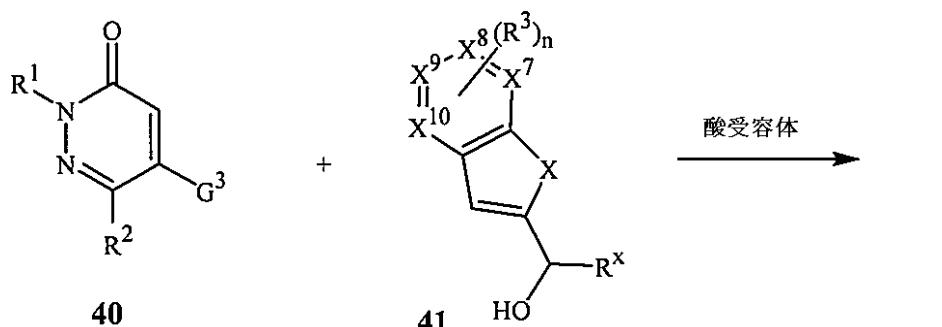
【0258】

式37の化合物は、スキーム23に示すように、式40のピリダジノンと式41のアルコールとの求核置換反応によっても製造可能である。適する溶媒としては、ジオキサン、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリジノン、ジメチルスルホキシド、およびジメチルホルムアミドが挙げられる。適する酸受容体としては、水素化ナトリウム、水素化カリウム、カリウムt-ブトキシド、ナトリウムヘキサメチルジシラジド、カリウムヘキサメチルジシラジド、およびリチウムヘキサメチルジシラジドが挙げられるが、これらに限定されない。

【0259】

【化40】

スキーム23



$G^3 =$ ハロゲン、 $\text{SO}_2(\text{C}_1\text{-}\text{C}_6\text{アルキル})$ 、

または SO_2 (場合により置換された
フェニルもしくは場合により置換された
5または6員環)

【0260】

式25の化合物は、式42の有機金属ピリダジノンカップリングパートナーと、ハロゲン化ヘテロアリールおよび式43のスルホナートとのカップリング反応によって製造可能である。有機金属カップリングパートナーは、例えば、有機亜鉛、有機マグネシウム、有機スズ、または有機ホウ素試薬とすることができます。パラジウムテトラキス(トリフェニルホスフィン)のようなパラジウム触媒、ならびに $\text{Pd}_{2}\text{dba}_3$ および $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ のような他のパラジウム源およびホスフィンまたはN-複素環式カルベンリガンドから生成された触媒をカップリング手順に使用することができる(Maesら、J.Org.Chem.、2011、76、9648~9659)。X-Phos、S-PhosおよびRu-Phosのようなジアルキルビアリールホスフィンリガンドに基づくパラジウムプレ触媒(Buchwaldら、Angew.Chem.Int.Ed.、2013、52(2)、615~619.)、またはPEPPSI-i-PrおよびPEPPSI-i

40

50

-PentのようなN-複素環式カルベンリガンドに由来するプレ触媒(Organら、Eur. J. Org. Chem. 2010、4343~4354)も、このカップリングに影響を及ぼすことができる。反応は、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、N-メチル-2-ピロリドン、およびジオキサンのような溶媒中で実行可能である。カップリングパートナーは、複素環式ハライドまたはスルホナートのいずれかであり得る。反応に特に有用なカップリングパートナーのクラスは、ヘテロ芳香族化合物のノナフラート(OSO₂C₄F₉)に基づくものである。ハロゲン化複素環式カップリングパートナーは、市販されているか、文献において公知である。とりわけ有用なハロゲン化ベンゾフランは、WO2003/043624に詳述されている方法によってハロゲン化フェノールから製造可能である。ハロゲン化チオフェノールからハロゲン化ベンゾチオフェンを製造するとりわけ有用な方法が、WO2001/002411に記載されている。複素環式ハライドの他の有用なクラスおよび合成経路は、Tetrahedron Organic Chemistry Series Vol. 26: Palladium in Heterocyclic Chemistry、第2版、GribbleおよびLi編、Elsevier、Amsterdam、2007に記載されている。

【0261】

【化41】

スキーム24



【0262】

ピリダジノンの4位の亜鉛化は、トルエン/テトラヒドロフラン中の2,2,6,6-ビス(テトラメチルピペリジン)亜鉛、塩化マグネシウム、塩化リチウム複合体(即ち、Zn(TMP)-LiClまたはZn(TMP)₂-MgCl₂-LiCl)のような亜鉛化試薬を用いて達成可能である。

【0263】

この位置のマグネシウム化(magnesiation)は、Mg(TMP)-LiClでの処理によっても達成可能である。ピリダジノンメタル化、ならびに4-亜鉛化および4-マグネシウム化ピリダジノンのパラジウム触媒クロスカップリングのための条件については、Verhelst, T., Ph.D. thesis, University of Antwerp, 2012を参照されたい。4-スタニルピリダジノンの合成およびクロスカップリング条件は、Stevensonら、J. Heterocyclic Chem. 2005, 42, 427により公知である。

【0264】

スキーム25に示すように、一般にはピリジン中の五硫化リン、または適切な溶媒(例えば、トルエン、テトラヒドロフラン、またはジオキサン)中のローソン試薬(2,4-ビス-(4-メトキシフェニル)-1,3-ジチア-2,4-ジホスフェタン2,4-ジスルフィド)であるチオン化試薬を用い、一般に0~室温の範囲の温度で式1aのピリダジノン(WはOである式1の化合物の部分集合)をチオン化(thionate)して式1cの対応するチオン(即ち、WはSである式1)を得ることができる。

【0265】

10

20

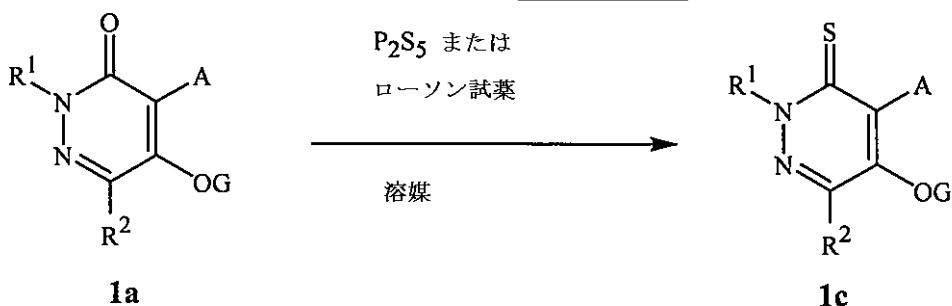
30

40

50

【化42】

スキーム25



【0266】

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

【0267】

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

【0268】

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

【0269】

更なる詳細がなくても、先行する記載を使用する当業者は、本発明を最大限に利用可能であると考えられる。以下の非限定的な実施例は本発明を例示するものである。以下の実施例における工程は、合成変換全体における各工程のための手法を例示するものであり、各工程のための出発材料は、必ずしも、手法が他の実施例または工程において記載されている特定の製造実験によって製造されていなくてもよい。パーセンテージは、クロマトグラフ溶媒混合物の場合、または、他に記載のある場合を除き、重量基準である。クロマトグラフ溶媒混合物に対する部およびパーセンテージは、別段の指示がない限り体積基準である。質量スペクトル(MS)は、H⁺(分子量1)の分子への付加により形成される同位体存在度が最も高い親イオン(M+1)の分子量、または、分子からのH⁺(分子量1)

10

20

30

40

50

) の損失により形成される (M - 1) の分子量として報告され、これらは、いずれかの大気圧化学イオン化 (AP+) を用いる質量分光計 (LCMS) に結合させた液体クロマトグラフィーを用いて観察した。ここで、「amu」は統一原子質量単位を意味する。NMRスペクトルは全て、別段の指示がない限り 400 MHz でのテトラメチルシランからの CDCl₃ 低磁場側において報告されており、s は一重項を意味し、brs は、広幅一重項を意味し、d は二重項を意味し、t は三重項を意味し、m は多重項を意味し、ddd は二重二重項の二重項を意味する。

【0270】

合成例 1

5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 4 - (2 - メチル - 7 - ベンゾフラニル) - 3 (2H) - ピリダジノン (化合物 12) の製造 10

工程 A : 1 - プロモ - 2 - (2 - プロピン - 1 - イルオキシ) - ベンゼンの製造

2 - プロモフェノール (15 g, 86.7 mmol) の N , N - ジメチルホルムアミド (225 mL) 溶液に臭化プロパルギル (トルエン中 80 %, 19.18 g, 130.05 mmol) と炭酸カリウム (24 g, 173.4 mmol) を添加し、室温で 16 時間攪拌した。反応混合物を H₂O でクエンチし、酢酸エチル (3 × 150 mL) 、続いてブライン溶液で抽出し、Na₂SO₄ 上で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。得られた粗物質を石油エーテル中 3 % 酢酸エチルで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製し、表題化合物を淡黄色液体 (12 g) として単離した。

¹H-NMR 2.43 (s, 1H), 4.78 (s, 2H), 6.91 (t, 1H), 7.08 (d, 1H), 7.28 (m, 1H), 20
7.56 (d, 1H).

【0271】

工程 B : 7 - プロモ - 2 - メチル - ベンゾフランの製造

1 - プロモ - 2 - (2 - プロピン - 1 - イルオキシ) - ベンゼン (即ち、実施例 1、工程 A で得られた生成物) (12 g, 56.87 mmol) の N , N - ジエチルアニリン (960 mL) 溶液に、フッ化セシウム (12.9 g, 85.30 mmol) を添加した。反応混合物を 230 °C で 5 時間攪拌した。反応混合物を周囲温度に冷却し、セライト床を通してろ過し、酢酸エチルで洗浄した。母液を 2 N 塩酸水溶液 (2 × 50 mL) 、続いてブライン溶液で洗浄し、Na₂SO₄ 上で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。粗残留物を、石油エーテル中 3 % 酢酸エチルで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製し、淡黄色液体 (9 g) を得た。M . S . = 210 (M + 1)。 30

【0272】

工程 C : 4 , 5 - ジクロロ - 6 - ヨード - 2 - メチル - 3 (2H) - ピリダジノンの製造

テトラヒドロフラン 80 mL に溶解させた 4 , 5 - ジクロロ - 2 - メチル - 3 (2H) - ピリダジノン (5.0 g, 27.9 mmol) に、トルエン / テトラヒドロフラン中の 2 , 2 , 6 , 6 ビス (テトラメチルピペリジン) 亜鉛、塩化マグネシウム、塩化リチウム複合体 0.35 M (即ち、テトラヒドロフラン / トルエン中の Zn (TMP)₂ - LiC₁-MgCl₂ 54 mL, 0.35 M) 18.75 mmol) を 3 ~ 5 分かけて添加した。混濁した反応混合物を 15 分間攪拌し、次いで、ヨウ素 (8.5 g, 33.51 mmol) を添加した。得られた混合物を周囲温度で 15 分間攪拌した。反応混合物を重亜硫酸ナトリウム水溶液で (過剰なヨウ素色を除くために) 、次いで水 (200 mL) 、続いて 1 N 塩酸水溶液 (100 mL) でクエンチした。混合物を酢酸エチル (300 mL 、次いで 200 mL) で抽出した。得られた粗生成物を、石油エーテル中 10 % 酢酸エチルで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製した。固体をジエチルエーテルとペンタンで粉碎し、得られた淡黄色固体を乾燥させた (3 g)。 40

¹H NMR 3.83 (s, 3H).

【0273】

工程 D : 5 - クロロ - 6 - ヨード - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 3 (2H) - ピリダジノンの製造

1 , 4 - ジオキサン (30 mL) 中の 4 , 5 - ジクロロ - 6 - ヨード - 2 - メチル - 3 50

(2H) - ピリダジノン(即ち、工程Cで得られた生成物)(3g、9.86mmol)に、ナトリウムメトキシド(メタノール中25%w/w溶液、2.72mL、12.63mmol)を添加し、得られた混合物を周囲温度で1時間攪拌した。反応混合物を飽和NH₄C1水溶液でクエンチし、酢酸エチル(100mL、次いで50mL)で2回抽出した。得られた粗生成物を石油エーテル中5%酢酸エチルで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製した。固体をジエチルエーテルとペンタンで粉碎し、得られたオフホワイト色固体を乾燥させた(2g)。

¹H NMR 3.75(s, 3H), 4.28(s, 3H).

【0274】

工程E：5-クロロ-4-メトキシ-2,6-ジメチル-3(2H)-ピリダジノンの製造 10

1,4-ジオキサン(20mL)中の5-クロロ-6-ヨード-4-メトキシ-2-メチル-3(2H)-ピリダジノン(即ち、工程Dで得られた生成物)(2g、6.66mmol)、トリメチルボロキシン(1.21mL、8.66mmol)、炭酸セシウム(6.50g、19.9mmol)、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム(I I)(0.27g、0.33mmol)の混合物を溶媒の還流温度で5時間加熱した。反応混合物を冷却し、ブラインと酢酸エチルの混合物でクエンチした。水層を酢酸エチル(40mL、次いで20mL)で2回抽出した。得られた残留物を、石油エーテル中5%酢酸エチルで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製し、固体をジエチルエーテルとペンタンで粉碎した。オフホワイト色固体を集め、乾燥させた(1g)。

¹H NMR 2.37(s, 3H), 3.72(s, 3H), 4.26(s, 3H).

【0275】

工程F：5-クロロ-2,6-ジメチル-4-(2-メチル-7-ベンゾフラニル)-3(2H)-ピリダジノンの製造

7-ブロモ-2-メチル-ベンゾフラン(即ち、実施例1、工程Bで得られた生成物)(1.0g、4.73mmol)の乾燥テトラヒドロフラン溶液に、n-ブチルリチウム(ヘキサン中2.5M、3.34g、5.68mmol)を-78で5分間滴加し、1.5時間攪拌し、続いて-78で5-クロロ-4-メトキシ-2,6-ジメチル-3(2H)-ピリダジノン(即ち、実施例1、工程Eで得られた生成物)を添加し、2.5時間攪拌した。反応混合物を飽和NH₄C1溶液でクエンチし、続いて酢酸エチル(3×10mL)、次いでブライン溶液で抽出し、Na₂SO₄上で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。得られた粗物質を石油エーテル中25%酢酸エチルで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製した。残留物をジエチルエーテルとペンタンで粉碎し、得られた固体を乾燥させて表題化合物250mgを白色固体として得た。M.P. 153~156。

【0276】

工程G：5-ヒドロキシ-2,6-ジメチル-4-(2-メチル-7-ベンゾフラニル)-3(2H)-ピリダジノン(化合物12)の製造

5-クロロ-2,6-ジメチル-4-(2-メチル-7-ベンゾフラニル)-3(2H)-ピリダジノン(即ち、実施例1、工程Fで得られた化合物)(200mg、0.69mmol)の1,4-ジオキサン(2mL)溶液に、水酸化テトラブチルアンモニウム(1mL)を添加し、得られた混合物を100で5時間攪拌した。反応混合物を水(3mL)で希釈し、1N塩酸溶液でpH=3に酸性化した。水層をジクロロメタン(3×5mL)で抽出し、ブライン溶液で洗浄し、次いで、Na₂SO₄上で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。得られた粗物質を、石油エーテル中60%酢酸エチルで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製した。得られた残留物をジエチルエーテルで粉碎し、得られた固体をペンタンで洗浄し乾燥させ、オフホワイト色固体(90mg)を得た。M.P.=272~275。

【0277】

10

20

30

40

50

合成例 2

5 - (アセチルオキシ) - 2 , 6 - ジメチル - 4 - (2 - メチル - 7 - ベンゾフラニル) - 3 (2 H) - ピリダジノン(化合物 13)の製造

工程 A : 5 - (アセチルオキシ) - 2 , 6 - ジメチル - 4 - (2 - メチル - 7 - ベンゾフラニル) - 3 (2 H) - ピリダジノン(化合物 13)の製造

5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 4 - (2 - メチル - 7 - ベンゾフラニル) - 3 (2 H) - ピリダジノン(即ち、実施例 1、工程 G で得られた化合物)(150 mg、0.55 mmol) のジクロロメタン溶液に、トリエチルアミン(0.2 mL、1.38 mmol) とアセチルクロリド(0.04 mL、0.61 mmol) を 0 度で添加した。得られた混合物を 0 度で 4 時間攪拌した。周囲温度に加温した後、水(5 mL) を添加し、得られた混合物をジクロロメタン(2 × 5 mL) で抽出し、水、続いて飽和 NaHCO₃ 水溶液、ブライン溶液で洗浄し、次いで、Na₂SO₄ 上で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。得られた粗物質を石油エーテル中 20% 酢酸エチルで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製し、ジエチルエーテルとペンタンで粉碎し、乾燥させ、淡褐色固体(100 mg)を得た。M.P. = 144 ~ 147。

【0278】

合成例 3

5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 4 - (5 - メチルベンゾ [b] チエン - 4 - イル) - 3 (2 H) - ピリダジノン(化合物 29)の製造

工程 A : 6 , 7 - ジヒドロ - 5 - メチル - ベンゾ [b] チオフェン - 4 (5 H) - オンの製造

6 , 7 - ジヒドロ - ベンゾ [b] チオフェン - 4 (5 H) - オン(10 g、65.8 mmol) のテトラヒドロフラン(100 mL) 溶液に、リチウムジイソプロピルアミド(7.74 g、72.6 mmol) を -78 度で 10 分間滴加した。得られた混合物を -78 度で 1 時間攪拌し、次いで、ヨードメタン(11.13 g、78.9 mmol) を添加し、混合物を -78 度で攪拌し、5 時間かけて周囲温度に温めた。反応混合物を飽和塩化アンモニウム溶液でクエンチし、酢酸エチル(3 × 10 mL)、続いてブライン溶液で抽出し、Na₂SO₄ 上で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。主成分を石油エーテル中 5% 酢酸エチルで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって単離し、表題化合物を淡黄色液体(3 g)として単離した。

【0279】

工程 B : エチル 2 - (6 , 7 - ジヒドロ - 5 - メチルベンゾ [b] チエン - 4 (5 H - イリデン) アセタート、およびエチル 6 , 7 - ジヒドロ - メチルベンゾ [b] チオフェン - 4 - アセタートの製造

乾燥エタノール 50 mL に、金属ナトリウム(5.3 g、240.9 mmol) を周囲温度で少しづつ添加し、2 時間攪拌した。トリエチルホスホノアセタートを周囲温度で添加し、10 分間攪拌し、続いて 6 , 7 - ジヒドロ - 5 - メチル - ベンゾ [b] チオフェン - 4 (5 H) - オン(即ち、実施例 3、工程 A で得られた化合物)を周囲温度で添加し、80 度で 16 時間攪拌した。反応混合物を周囲温度に冷却し、次いで、氷水に注いだ。混合物を酢酸エチル(3 × 50 mL) で抽出し、一体化した有機層をブライン溶液で洗浄し、Na₂SO₄ 上で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。得られた残留物を石油エーテル中 4% 酢酸エチルで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製し、表題化合物の混合物を、表題成分の混合物として単離し、濃縮し、淡黄色液体(2 g)を得た。表題化合物の混合物は、更なる精製を加えることなく次の工程に進めた。M.S. = 237 (M + H)。

【0280】

工程 C : エチル 5 - メチルベンゾ [b] チオフェン - 4 - アセタートの製造

エチル 2 - (6 , 7 - ジヒドロ - 5 - メチルベンゾ [b] チエン - 4 (5 H - イリデン) アセタートとエチル 6 , 7 - ジヒドロ - メチルベンゾ [b] チオフェン - 4 - アセタートの混合物(7 g、29.66 mmol)(即ち、実施例 3、工程 B で得られた化合物)

10

20

30

40

50

のトルエン(150mL)溶液に、2,3-ジクロロ-5,6-ジシアノ-1,4-ベンゾキノン(DDQ、16.8g、74.15mmol)を周囲温度で添加し、得られた混合物を100で24時間攪拌した。次いで、反応混合物をCelite(登録商標)ケイ藻土ろ過助剤を通してろ過し、トルエンで洗浄し、ろ液を濃縮した。得られた物質を石油エーテル中8%酢酸エチルで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製し、淡黄色液体(2.5g)を単離した。M.S.=235(M+H)。

【0281】

工程D：5-メチルベンゾ[b]チオフェン-4-酢酸の製造

エチル5-メチルベンゾ[b]チオフェン-4-アセタート(即ち、実施例3、工程Cで得られた化合物)のテトラヒドロフランとH₂Oの混合物(8:2、25mL)の溶液に、水酸化リチウム(1g、42.7mmol)を添加し、得られた混合物を周囲温度で5時間攪拌した。水(20mL)を添加し、得られた混合物を酢酸エチル(2×10mL)で抽出した。水層を1N塩酸水溶液で酸性化しpH=3に調整した。次いで、水層をジクロロメタン(3×10mL)で抽出し、一体化した有機層をブラインで洗浄し、Na₂SO₄上で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。得られた残留物をジエチルエーテルとペンタンで粉碎し、オフホワイト色の固体(2.1g)を得た。M.P.=152~155。

【0282】

工程E：5-メチルベンゾ[b]チオフェン-4-酢酸1-メチルヒドラジドの製造

5-メチルベンゾ[b]チオフェン-4-酢酸のジクロロメタン溶液(即ち、実施例3、工程Dで得られた化合物)(5mL)に、N-(3-ジメチルアミノプロピル)-N'-エチルカルボジイミドヒドロクロリド(EDC、0.58g、1.1mmol)とペニタフルオロフェノール(0.49g、1.1mmol)を周囲温度で添加し、得られた混合物を3時間攪拌した。別の丸底フラスコで、硫酸メチルヒドラジン(1.0g、3mmol)をジクロロメタン(5mL)に溶解させ、ジ-イソプロピルエチルアミン(0.93g、3mmol)を添加し、得られた混合物を周囲温度で15分間攪拌した。次いで、先に製造した5-メチルベンゾ[b]チオフェン-4-酢酸とEDCの混合物をこの溶液に添加し、得られた混合物を周囲温度で30分間攪拌した。水(5mL)を反応混合物に添加し、次いで、ジクロロメタン(3×5mL)で抽出した。一体化した有機層を水、続いてブライン溶液で洗浄し、Na₂SO₄上で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。得られた粗化合物をジエチルエーテルで粉碎し、表題化合物を得、これをその後の工程で使用した(0.55g、粗製)。

【0283】

工程F：5-メチルベンゾ[b]チオフェン-4-酢酸2-(2-エトキシ-1-メチル-2-オキソエチリデン)-1-メチルヒドラジドの製造

上記実施例3、工程Eで単離した5-メチルベンゾ[b]チオフェン-4-酢酸1-メチルヒドラジドのエタノール(5mL)中粗混合物に、ピルビン酸エチル(0.41g、1.5mmol)を周囲温度で添加し、得られた混合物を16時間攪拌した。反応混合物を減圧下で濃縮し、水(5mL)を添加した。混合物をジクロロメタン(3×5mL)で抽出し、一体化した有機層をブライン溶液で洗浄し、Na₂SO₄上で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。得られた粗混合物を、石油エーテル中15%酢酸エチルで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製し、淡褐色固体をジエチルエーテルとペンタンで粉碎した(0.2g)。M.S.=333(M+H)。

【0284】

工程H：5-ヒドロキシ-2,6-ジメチル-4-(5-メチルベンゾ[b]チエン-4-イル)-3(2H)-ピリダジノン(化合物29)の製造

5-メチルベンゾ[b]チオフェン-4-酢酸2-(2-エトキシ-1-メチル-2-オキソエチリデン)-1-メチルヒドラジドのアセトニトリル(2mL)溶液に、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン(0.45g、5.0mmol)を0で添加した。得られた混合物を、周囲温度で2日間攪拌した。反応混合物を減圧下で濃縮し、水を添加し、続いて2N塩酸水溶液を添加してpH=3に調整した。水層をジク

10

20

30

40

50

クロロメタン(3×5mL)で抽出し、一体化した有機層をブライン溶液で洗浄し、Na₂SO₄上で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。得られた粗反応混合物を、石油エーテル中50%酢酸エチルで溶出するシリカゲルクロマトグラフィーによって精製した。固体をジエチルエーテルとペンタンで粉碎し、本発明の化合物であるオフホワイト色固体を得、これを乾燥させた(0.1g)。M.P.=204~207。

【0285】

合成例4

6-クロロ-5-ヒドロキシ-4-(1-イソキノリニル)-2-メチル-3(2H)-ピリダジノン(化合物67)の製造

工程A：6-クロロ-5-メトキシ-2-メチル-4-(トリメチルスタンニル)-3(2H)-ピリダジノンの製造

6-クロロ-5-メトキシ-2-メチル-3(2H)-ピリダジノン(U.S.2013/0331382に記載されているように製造)(550mg、3.15mmol)のテトラヒドロフラン(6mL)懸濁液に、予冷した(-20)2,2,6,6-ビス(テトラメチルピペリジン)亜鉛、塩化マグネシウム、塩化リチウム複合体(7.0mL、7.0mmol、テトラヒドロフラン/トルエン中1.0M)の溶液を-20で30秒以内に添加した。得られた反応混合物を-20で40秒間攪拌し、次いで、塩化トリメチルスズ(テトラヒドロフラン中1.0M、8.0mL、8.0mmol)の溶液を反応混合物に-20で一度に添加した。-20で0.5時間攪拌した後、反応混合物を飽和NH₄Cl水溶液でクエンチし、次いで、酢酸エチルで抽出した。有機層をブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄で乾燥させ、濃縮し、残留物をカラムクロマトグラフィーによって精製し、表題化合物600mgを無色油状物として得た。

¹H NMR 3.84(s, 3H), 3.70(s, 3H), 0.41(s, 9H).

【0286】

工程B：6-クロロ-4-(1-イソキノリニル)-5-メトキシ-2-メチル-3(2H)-ピリダジノンの製造

反応バイアル中の1-ヨードイソキノリン(310mg、1.22mmol)、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)(69mg、0.06mmol)およびヨウ化銅(I)(116mg、0.61mmol)の混合物を真空下で排気し、次いで、窒素ガスを再充填した。この手順を3回繰り返した後、混合物を窒素下で6-クロロ-5-メトキシ-2-メチル-4-(トリメチルスタンニル)-3(2H)-ピリダジノン(即ち、実施例4、工程Aからの生成物)(485mg、1.44mmol)の1,4-ジオキサン(3mL)溶液に添加した。得られた反応混合物を90で4時間攪拌し、次いで、室温に冷却し、Celite(登録商標)ケイ藻土ろ過助剤の短パッドを通してろ過し、ジクロロメタンですすいだ。ろ液を濃縮し、残留物をカラムクロマトグラフィーによって精製し、表題化合物(200mg)を黄色半固体として得た。

¹H NMR 8.61(d, 1H), 7.88(d, 1H), 7.76(d, 1H), 7.73(d, 1H), 7.70(ddd, 1H), 7.60(ddd, 1H), 3.76(s, 3H), 3.33(s, 3H).

【0287】

工程C：6-クロロ-5-ヒドロキシ-4-(1-イソキノリニル)-2-メチル-3(2H)-ピリダジノンの製造

6-クロロ-4-(1-イソキノリニル)-5-メトキシ-2-メチル-3(2H)-ピリダジノン(即ち、実施例4、工程Bの生成物)(200mg、0.66mmol)のモルホリン(1mL)中混合物を100で1時間攪拌した。次いで、反応混合物を減圧下で濃縮し、過剰なモルホリンを除去した。残留物に2.0N塩酸水溶液を添加し、慎重にpHを2~3に調整した。得られた黄色沈殿物をろ過によって集め、水ですすぎ、乾燥させ、表題化合物(130mg)を得た。

¹H NMR (dmso d6) 9.00(brs, 1H), 8.51(d, 1H), 8.29(d, 1H), 8.25(d, 1H), 8.17(d, 1H), 8.10(ddd, 1H), 7.84(ddd, 1H), 3.09(s, 3H).

【0288】

20

30

50

合成例 5

4 - (4 - フルオロ - 7 - ベンゾフラニル) - 5 - メトキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 6 9) の製造

工程 A : 5 - メトキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノンの製造

6 - クロロ - 5 - メトキシ - 2 - メチル - 3 (2 H) - ピリダジノン (U . S . 2 0 1 3 / 0 3 3 1 3 8 2 に記載されているように製造) (3 . 1 8 g 、 1 8 . 2 1 m m o l) 、クロロ (2 - ジシクロヘキシルホスフィノ - 2 ' , 6 ' - ジメトキシ - 1 , 1 ' - ビフェニル) [2 - (2 ' - アミノ - 1 , 1 ' - ビフェニル)] パラジウム (I I) (S P h o s - P d - G 2) (1 . 3 g 、 1 . 8 2 m m o l) 、トリメチルボロキシン (1 . 9 m L 、 1 3 . 6 m m o l) 、および炭酸セシウム (8 . 9 g 、 2 7 . 3 m m o l) を 1 , 4 - ジオキサン (5 0 m L) 中で混ぜ合わせ、窒素雰囲気下 8 0 °C で一晩攪拌した。周囲温度に冷却した後、反応混合物をジクロロメタン (1 0 0 m L) で希釈した。得られたスラリーを C e l i t e (登録商標) ケイ藻土ろ過助剤のパッドを通してろ過した。ろ液を分液漏斗に移し、飽和塩化アンモニウム水溶液で洗浄した。有機層を分離し、M g S O 4 上で乾燥させ、シリカゲルに吸収させた。ヘキサン中酢酸エチル勾配 2 0 ~ 1 0 0 % を用いたシリカゲル (4 0 g) 液体クロマトグラフィーによって精製を行った。単離した画分を合わせて濃縮し、表題化合物 (2 . 5 2 g) を白色固体として得た。

¹H NMR δ: 6.11 (s , 1H) , 3.80 (s , 3H) , 3.68 (s , 3H) , 2.22 (s , 3H) .

【 0 2 8 9 】

工程 B : 4 - (4 - フルオロ - 7 - ベンゾフラニル) - 5 - メトキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノンの製造

乾燥した 2 口丸底フラスコにゴムセプタムと二方弁アダプタを取り付け、一方の弁は高真空ラインに繋ぎ、他方は窒素のバルーンに繋いだ。2 口丸底フラスコに、5 - メトキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノン (0 . 7 0 g 、 4 . 5 m m o l) 、7 - プロモ - 4 - フルオロ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン (1 . 0 7 g 、 5 . 0 m m o l) 、クロロ (2 - ジシクロヘキシルホスフィノ - 2 ' , 6 ' - ジメトキシ - 1 , 1 ' - ビフェニル) [2 - (2 ' - アミノ - 1 , 1 ' - ビフェニル)] パラジウム (I I) (S P h o s - P d - G 2) (0 . 1 6 2 g 、 0 . 2 2 5 m m o l) 、および 2 - ジシクロヘキシルホスフィノ - 2 ' , 6 ' - ジメトキシビフェニル (S P h o s) (0 . 0 9 2 g 、 0 . 2 2 5 m m o l) を充填した。フラスコを窒素下でシールし、排気し、再度窒素を充填した。これを 3 回繰り返した。次いで、無水テトラヒドロフラン (2 0 m L) をシリングに取り、窒素雰囲気下でゴムセプタムを通して反応容器に添加した。次いで、2 , 2 , 6 , 6 - ビス (テトラメチルピペリジン) 亜鉛、塩化リチウム複合体 (テトラヒドロフラン中 1 7 % 、 7 . 8 m L 、 5 . 4 m m o l) を、ゴムセプタムを通してシリングで反応混合物に添加した。得られた褐色溶液を窒素雰囲気下 4 7 °C で一晩攪拌した。

【 0 2 9 0 】

室温に冷却した後、反応混合物を塩酸水溶液 (1 N 、 5 0 m L) に注ぎ、酢酸エチル (4 × 3 0 m L) 中に抽出した。有機抽出物を合わせ、M g S O 4 上で乾燥させ、シリカゲルに吸収させた。ヘキサン中酢酸エチル勾配 0 ~ 1 0 0 % を用いたシリカゲル (4 0 g) 液体クロマトグラフィーによって精製を行った。得られた単離画分を合わせ、減圧下で溶媒を除去し、表題化合物 (1 . 1 5 g) を黄色固体として得た。M . S . = 2 8 9 (A P +) 。

【 0 2 9 1 】

合成例 6

4 - (4 - フルオロ - 7 - ベンゾフラニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノン (化合物 6 8) の製造

工程 A : 4 - (4 - フルオロ - 7 - ベンゾフラニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノンの製造

星形攪拌子を備えた 1 0 m L マイクロ波バイアル中の 4 - (4 - フルオロ - 7 - ベンゾフラニル) - 5 - メトキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノン (即ち、実施

10

20

30

40

50

例5、工程Bの生成物、1.00g、3.5mmolに、モルホリン(3mL)を添加した。容器をシールし、マイクロ波中、140で10分間反応させた。周囲温度に冷却すると、白色固体が形成された。ジオキサン(5mL)を添加し、次いで、過剰な溶媒を減圧下で除去した。次いで、塩酸水溶液(1N、10mL)を添加し、得られた白色固体を2%ヘキサンを含む水と共にろ過し、フリット上で乾燥させ、表題化合物0.89gを得た。M.S.=275(AP+)。

【0292】

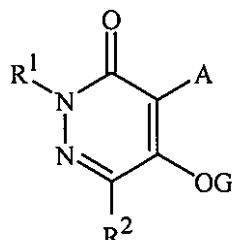
当技術分野で公知の方法と共に本明細書に記載の手順により、以下の表1～271の化合物を製造することができる。以下の表において、以下の略語が使用されている：tは第三級を意味し、iはイソを意味し、Meはメチルを意味し、Etはエチルを意味し、i-Prはイソプロピルを意味し、Buはブチルを意味し、c-Prはシクロプロピルを意味し、OMeはメトキシを意味し、OEtはエトキシを意味し、-CNはシアノを意味する。以下の表に別段の指示がない限り、X¹、X²、X³、X⁴、X⁵、X⁶、X⁷、X⁸、X⁹およびX¹⁰のそれぞれは、CHである。

10

【0293】

【化43】

表1



20

R¹はCH₃であり、R²はCH₃であり、GはHであり、Aは、以下の通りである。

【0294】

30

【表8】

【表9】

A-2(Y ² は、Oであり、X ¹ は、CCH ₃ であり、 X ⁵ は、CClである)	A-3(X ⁷ は、Nであり、X ³ は、CClである)
A-2(Y ² は、Oであり、X ¹ は、CCH ₃ であり、 X ⁵ は、CCH ₃ である)	A-3(X ⁷ は、Nであり、X ³ は、COMeである)
A-2(Y ² は、Oであり、X ¹ は、CCH ₃ であり、 X ³ は、CClであり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	A-3(X ⁷ は、Nであり、X ³ は、CCH ₃ である)
A-2(Y ² は、Oであり、X ³ は、CClであり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	A-3(X ⁷ は、Nであり、X ¹ は、CCH ₃ である)
A-2(Y ² は、Oであり、X ³ は、CClであり、X ⁵ は、CClである)	A-3(X ⁸ は、Nである)*
A-2(Y ² は、Sであり、X ⁵ は、Nである)	A-3(X ⁸ は、Nであり、X ³ は、CClである)
A-2(Y ² は、Oであり、X ⁵ は、Nである)	A-3(X ⁸ は、Nであり、X ³ は、COMeである)
A-2(Y ² は、Sであり、X ⁴ は、Nである)	A-3(X ⁸ は、Nであり、X ³ は、CCH ₃ である)
A-2(Y ² は、Oであり、X ⁴ は、Nである)	A-3(X ⁸ は、Nであり、X ¹ は、CCH ₃ である)
A-2(Y ² は、NCH ₃ である)	A-3(X ⁹ は、Nである)*
A-2(Y ² は、NCH ₃ であり、X ⁴ は、Nである)	A-3(X ⁹ は、Nであり、X ³ は、CClである)
A-2(Y ² は、Sであり、X ¹ は、Nである)	A-3(X ⁹ は、Nであり、X ³ は、COMeである)
A-2(Y ² は、Sであり、X ² は、Nである)	A-3(X ⁹ は、Nであり、X ³ は、CCH ₃ である)
A-2(Y ² は、Sであり、X ³ は、Nである)	A-3(X ⁹ は、Nであり、X ¹ は、CCH ₃ である)
A-2(Y ² は、NCH ₃ であり、X ⁴ は、Nである)	A-3(X ¹⁰ は、Nである)
A-2(Y ² は、NCH ₃ であり、X ⁵ は、Nであり、 X ⁴ は、Nである)	A-3(X ¹⁰ は、Nであり、X ³ は、CClである)
A-3(X ¹ は、Nである)	A-3(X ¹⁰ は、Nであり、X ³ は、COMeである)
A-3(X ¹ は、Nであり、X ³ は、CClである)	A-3(X ¹⁰ は、Nであり、X ³ は、CCH ₃ である)
A-3(X ¹ は、Nであり、X ³ は、COMeである)	A-3(X ¹⁰ は、Nであり、X ¹ は、CCH ₃ である)
A-3(X ¹ は、Nであり、X ³ は、CCH ₃ である)	A-3(X ¹ は、Nであり、X ³ は、Nである)
A-3(X ² は、Nである)*	A-3(X ¹ は、Nであり、X ² は、Nである)
A-3(X ² は、Nであり、X ³ は、CClである)	A-3(X ¹ は、Nであり、X ² は、Nであり、X ³ は、CClである)
A-3(X ² は、Nであり、X ³ は、COMeである)	A-3(X ² は、Nであり、X ³ は、Nである)
A-3(X ² は、Nであり、X ³ は、CCH ₃ である)	A-3(X ⁸ は、Nであり、X ¹⁰ は、Nである)
A-3(X ³ は、Nである)*	A-3(X ⁹ は、Nであり、X ¹⁰ は、Nである)
A-3(X ³ は、Nであり、X ¹ は、CClである)	A-3(X ⁷ は、Nであり、X ¹⁰ は、Nである)
A-3(X ³ は、Nであり、X ¹ は、COMeである)	A-3(X ⁷ は、Nであり、X ¹⁰ は、Nであり、X ³ は、CClである)
A-3(X ³ は、Nであり、X ¹ は、CCH ₃ である)	A-3(X ⁷ は、Nであり、X ¹⁰ は、Nである)
A-3(X ³ は、Nであり、X ⁹ は、CClである)	A-3(X ⁷ は、Nであり、X ⁹ は、Nである)
A-3(X ³ は、Nであり、X ¹ は、CCH ₃ であり、 X ⁹ は、CClである)	A-3(X ⁷ は、Nであり、X ⁸ は、Nである)
A-3(X ⁷ は、Nである)*	A-3(X ⁷ は、Nであり、X ⁸ は、Nであり、X ³ は、CClである)

【表10】

A-3(X ¹ は、 N であり、 X ⁸ は、 N であり、 X ³ は、 CCH ₃ である)	A-4(Y ⁴ は、 S であり、 X ⁸ は、 N である)
A-3(X ¹ は、 N であり、 X ⁷ は、 N である)	A-4(Y ⁴ は、 S であり、 X ⁷ は、 N である)
A-3(X ¹ は、 N であり、 X ⁸ は、 N である)	A-4(Y ⁴ は、 O であり、 X ¹⁰ は、 N である)
A-3(X ¹ は、 N であり、 X ⁸ は、 N である)	A-4(Y ⁴ は、 O であり、 X ⁹ は、 N である)
A-3(X ¹ は、 N であり、 X ¹⁰ は、 N である)	A-4(Y ⁴ は、 O であり、 X ⁸ は、 N である)
A-3(X ² は、 N であり、 X ¹⁰ は、 N である)	A-4(Y ⁴ は、 O であり、 X ⁷ は、 N である)
A-3(X ² は、 N であり、 X ⁹ は、 N である)	A-4(Y ⁴ は、 NCH ₃ であり、 X ¹⁰ は、 N である) 10
A-3(X ² は、 N であり、 X ⁸ は、 N である)	A-4(Y ⁴ は、 NCH ₃ であり、 X ⁹ は、 N である)
A-3(X ² は、 N であり、 X ⁸ は、 N である)	A-4(Y ⁴ は、 NCH ₃ であり、 X ⁸ は、 N である)
A-3(X ² は、 N であり、 X ⁷ は、 N である)	A-4(Y ⁴ は、 NCH ₃ であり、 X ⁷ は、 N である)
A-3(X ³ は、 N であり、 X ¹⁰ は、 N である)	A-4(Y ⁴ は、 NCH ₃ であり、 X ¹ は、 N であり、 X ¹⁰ は、 N である)
A-3(X ³ は、 N であり、 X ⁹ は、 N である)	A-4(Y ⁴ は、 NCH ₃ であり、 X ¹ は、 N であり、 X ⁹ は、 N である)
A-3(X ³ は、 N であり、 X ⁸ は、 N である)	A-4(Y ⁴ は、 NCH ₃ であり、 X ¹ は、 N であり、 X ⁸ は、 N である) 20
A-3(X ³ は、 N であり、 X ⁷ は、 N である)	A-4(Y ⁴ は、 NCH ₃ であり、 X ¹ は、 N であり、 X ⁷ は、 N である)
A-4(Y ⁴ は、 S であり、 X ¹⁰ は、 N である)	
A-4(Y ⁴ は、 S であり、 X ⁹ は、 N である)	

*表47、49、56および58には適用されない。

【0297】

表2は、表題行（即ち、「R¹ は、 CH₃ であり、 R² は、 CH₃ であり、 G は、 H であり、 A は、以下の通りである。」）が、以下の表2の表題行（即ち、「R¹ は、 Me であり、 R² は、 Me であり、 G は、 C(O)Me である。」）に置き換えられていることを除き、表1と同様に構成されている。従って、表2の最初の項目は、 W は、 O であり、 A は、 A - 1 (Y¹ は、 S であり、 X¹ は、 CH であり、 X² は、 CH であり、 X³ は、 CH であり、 X⁵ は、 CH であり、 X⁶ は、 CH である) であり、 R¹ は、 Me であり、 R² は、 Me であり、 G は、 C(O)Me である式1の化合物となる。表3～288も同様に構成されている。 30

【0298】

【表 1 1】

表	表題行	表	表題行
2	R ¹ は、Me であり、R ² は、Me であり、G は、C(O)Me である。	19	R ¹ は、Me であり、R ² は、H であり、G は、SO ₂ Me である。
3	R ¹ は、Me であり、R ² は、Me であり、G は、C(O)Et である。	20	R ¹ は、Me であり、R ² は、Et であり、G は、C(O)Me である。
4	R ¹ は、Me であり、R ² は、Me であり、G は、C(O)-i-Pr である。	21	R ¹ は、Me であり、R ² は、Et であり、G は、C(O)Et である。10
5	R ¹ は、Me であり、R ² は、Me であり、G は、C(O)-Ph である。	22	R ¹ は、Me であり、R ² は、Et であり、G は、H である。
6	R ¹ は、Me であり、R ² は、Me であり、G は、CO ₂ Me である。	23	R ¹ は、Me であり、R ² は、Et であり、G は、C(O)-Ph である。
7	R ¹ は、Me であり、R ² は、Me であり、G は、CO ₂ Et である。	24	R ¹ は、Me であり、R ² は、Et であり、G は、CO ₂ Me である。
8	R ¹ は、Me であり、R ² は、Me であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。	25	R ¹ は、Me であり、R ² は、Et であり、G は、CO ₂ Et である。20
9	R ¹ は、Me であり、R ² は、Me であり、G は、CH ₂ OMe である。	26	R ¹ は、Me であり、R ² は、Et であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。
10	R ¹ は、Me であり、R ² は、Me であり、G は、SO ₂ Me である。	27	R ¹ は、Me であり、R ² は、Et であり、G は、CH ₂ OMe である。
11	R ¹ は、Me であり、R ² は、H であり、G は、C(O)Me である。	28	R ¹ は、Me であり、R ² は、Et であり、G は、SO ₂ Me である。
12	R ¹ は、Me であり、R ² は、H であり、G は、C(O)Et である。	29	R ¹ は、Me であり、R ² は、Pr であり、G は、C(O)Me である。30
13	R ¹ は、Me であり、R ² は、H であり、G は、H である。	30	R ¹ は、Me であり、R ² は、Pr であり、G は、C(O)Et である。
14	R ¹ は、Me であり、R ² は、H であり、G は、C(O)-Ph である。	31	R ¹ は、Me であり、R ² は、Pr であり、G は、H である。
15	R ¹ は、Me であり、R ² は、H であり、G は、CO ₂ Me である。	32	R ¹ は、Me であり、R ² は、Pr であり、G は、C(O)-Ph である。
16	R ¹ は、Me であり、R ² は、H であり、G は、CO ₂ Et である。	33	R ¹ は、Me であり、R ² は、Pr であり、G は、CO ₂ Me である。
17	R ¹ は、Me であり、R ² は、H であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。	34	R ¹ は、Me であり、R ² は、Pr であり、G は、CO ₂ Et である。40
18	R ¹ は、Me であり、R ² は、H であり、G は、CH ₂ OMe である。	35	R ¹ は、Me であり、R ² は、Pr であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。

【0299】

【表 1 2】

表	表題行		表	表題行
36	R ¹ は、Me であり、R ² は、Pr であり、G は、CO ₂ -i-Bu である。		54	R ¹ は、Me であり、R ² は、Cl であり、G は、CH ₂ OMe である。
37	R ¹ は、Me であり、R ² は、Pr であり、G は、SO ₂ Me である。		55	R ¹ は、Me であり、R ² は、Cl であり、G は、SO ₂ Me である。
38	R ¹ は、Me であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、C(O)Me である。		56	R ¹ は、Me であり、R ² は、Br であり、G は、C(O)Me である。10
39	R ¹ は、Me であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、C(O)Et である。		57	R ¹ は、Me であり、R ² は、Br であり、G は、C(O)Et である。
40	R ¹ は、Me であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、H である。		58	R ¹ は、Me であり、R ² は、Br であり、G は、H である。
41	R ¹ は、Me であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、C(O)-Ph である。		59	R ¹ は、Me であり、R ² は、Br であり、G は、C(O)-Ph である。
42	R ¹ は、Me であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、CO ₂ Me である。		60	R ¹ は、Me であり、R ² は、Br であり、G は、CO ₂ Me である。20
43	R ¹ は、Me であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、CO ₂ Et である。		61	R ¹ は、Me であり、R ² は、Br であり、G は、CO ₂ Et である。
44	R ¹ は、Me であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。		62	R ¹ は、Me であり、R ² は、Br であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。
45	R ¹ は、Me であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、CH ₂ OMe である。		63	R ¹ は、Me であり、R ² は、Br であり、G は、CH ₂ OMe である。
46	R ¹ は、Me であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、SO ₂ Me である。		64	R ¹ は、Me であり、R ² は、Br であり、G は、SO ₂ Me である。30
47	R ¹ は、Me であり、R ² は、Cl であり、G は、C(O)Me である。		65	R ¹ は、Me であり、R ² は、I であり、G は、C(O)Me である。
48	R ¹ は、Me であり、R ² は、Cl であり、G は、C(O)Et である。		66	R ¹ は、Me であり、R ² は、I であり、G は、C(O)Et である。
49	R ¹ は、Me であり、R ² は、Cl であり、G は、H である。		67	R ¹ は、Me であり、R ² は、I であり、G は、H である。
50	R ¹ は、Me であり、R ² は、Cl であり、G は、C(O)-Ph である。		68	R ¹ は、Me であり、R ² は、I であり、G は、C C(O)-Ph である。
51	R ¹ は、Me であり、R ² は、Cl であり、G は、CO ₂ Me である。		69	R ¹ は、Me であり、R ² は、I であり、G は、CO ₂ Me である。40
52	R ¹ は、Me であり、R ² は、Cl であり、G は、CO ₂ Et である。		70	R ¹ は、Me であり、R ² は、I であり、G は、CO ₂ Et である。
53	R ¹ は、Me であり、R ² は、Cl であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。		71	R ¹ は、Me であり、R ² は、I であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。

【0300】

【表 1 3】

表	表題行		表	表題行
72	R ¹ は、Me であり、R ² は、I であり、G は、CH ₂ OMe である。		90	R ¹ は、Me であり、R ² は、OEt であり、G は、CH ₂ OMe である。
73	R ¹ は、Me であり、R ² は、I であり、G は、SO ₂ Me である。		91	R ¹ は、Me であり、R ² は、OEt であり、G は、SO ₂ Me である。
74	R ¹ は、Me であり、R ² は、OMe であり、G は、C(O)Me である。			R ¹ は、Et であり、R ² は、Me であり、G は、C(O)Me である。 10
75	R ¹ は、Me であり、R ² は、OMe であり、G は、C(O)Et である。		92	R ¹ は、Et であり、R ² は、Me であり、G は、C(O)Et である。
76	R ¹ は、Me であり、R ² は、OMe であり、G は、H である。		93	R ¹ は、Et であり、R ² は、Me であり、G は、H である。
77	R ¹ は、Me であり、R ² は、OMe であり、G は、C(O)-Ph である。		94	R ¹ は、Et であり、R ² は、Me であり、G は、H である。
78	R ¹ は、Me であり、R ² は、OMe であり、G は、CO ₂ Me である。		95	R ¹ は、Et であり、R ² は、Me であり、G は、C(O)-Ph である。
79	R ¹ は、Me であり、R ² は、OMe であり、G は、CO ₂ Et である。		96	R ¹ は、Et であり、R ² は、Me であり、G は、CO ₂ Me である。
80	R ¹ は、Me であり、R ² は、OMe であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。		97	R ¹ は、Et であり、R ² は、Me であり、G は、CO ₂ Et である。
81	R ¹ は、Me であり、R ² は、OMe であり、G は、CH ₂ OMe である。		98	R ¹ は、Et であり、R ² は、Me であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。
82	R ¹ は、Me であり、R ² は、OMe であり、G は、SO ₂ Me である。		99	R ¹ は、Et であり、R ² は、Me であり、G は、CH ₂ OMe である。
83	R ¹ は、Me であり、R ² は、OEt であり、G は、C(O)Me である。		100	R ¹ は、Et であり、R ² は、Me であり、G は、SO ₂ Me である。 30
84	R ¹ は、Me であり、R ² は、OEt であり、G は、C(O)Et である。		101	R ¹ は、Et であり、R ² は、H であり、G は、C(O)Me である。
85	R ¹ は、Me であり、R ² は、OEt であり、G は、H である。		102	R ¹ は、Et であり、R ² は、H であり、G は、C(O)Et である。
86	R ¹ は、Me であり、R ² は、OEt であり、G は、C(O)-Ph である。		103	R ¹ は、Et であり、R ² は、H であり、G は、H である。
87	R ¹ は、Me であり、R ² は、OEt であり、G は、CO ₂ Me である。		104	R ¹ は、Et であり、R ² は、H であり、G は、C(O)-Ph である。 40
88	R ¹ は、Me であり、R ² は、OEt であり、G は、CO ₂ Et である。		105	R ¹ は、Et であり、R ² は、H であり、G は、CO ₂ Me である。
89	R ¹ は、Me であり、R ² は、OEt であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。		106	R ¹ は、Et であり、R ² は、H であり、G は、CO ₂ Et である。
			107	R ¹ は、Et であり、R ² は、H であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。

【0301】

【表 1 4】

表	表題行		表	表題行
108	R ¹ は、Et であり、R ² は、H であり、 G は、CH ₂ OMe である。		126	R ¹ は、Et であり、R ² は、Pr であり、 G は、CH ₂ OMe である。
109	R ¹ は、Et であり、R ² は、H であり、 G は、SO ₂ Me である。		127	R ¹ は、Et であり、R ² は、Pr であり、 G は、SO ₂ Me である。
110	R ¹ は、Et であり、R ² は、Et であり、 G は、C(O)Me である。		128	R ¹ は、Et であり、R ² は、CF ₃ であり、 G は、C(O)Me である。 10
111	R ¹ は、Et であり、R ² は、Et であり、 G は、C(O)Et である。		129	R ¹ は、Et であり、R ² は、CF ₃ であり、 G は、C(O)Et である。
112	R ¹ は、Et であり、R ² は、Et であり、 G は、H である。		130	R ¹ は、Et であり、R ² は、CF ₃ であり、 G は、H である。
113	R ¹ は、Et であり、R ² は、Et であり、 G は、C(O)-Ph である。		131	R ¹ は、Et であり、R ² は、CF ₃ であり、 G は、C(O)-Ph である。
114	R ¹ は、Et であり、R ² は、Et であり、 G は、CO ₂ Me である。		132	R ¹ は、Et であり、R ² は、CF ₃ であり、 G は、CO ₂ Me である。 20
115	R ¹ は、Et であり、R ² は、Et であり、 G は、CO ₂ Et である。		133	R ¹ は、Et であり、R ² は、CF ₃ であり、 G は、CO ₂ Et である。
116	R ¹ は、Et であり、R ² は、Et であり、 G は、CH ₂ OMe である。		134	R ¹ は、Et であり、R ² は、CF ₃ であり、 G は、CO ₂ -i-Pr である。
117	R ¹ は、Et であり、R ² は、Et であり、 G は、CO ₂ -t-Bu である。		135	R ¹ は、Et であり、R ² は、CF ₃ であり、 G は、CH ₂ OMe である。
118	R ¹ は、Et であり、R ² は、Et であり、 G は、SO ₂ Me である。		136	R ¹ は、Et であり、R ² は、Cl であり、 G は、C(O)Me である。 30
119	R ¹ は、Et であり、R ² は、Pr であり、 G は、C(O)Me である。		137	R ¹ は、Et であり、R ² は、Cl であり、 G は、C(O)Me である。
120	R ¹ は、Et であり、R ² は、Pr であり、 G は、C(O)Et である。		138	R ¹ は、Et であり、R ² は、Cl であり、 G は、C(O)Et である。
121	R ¹ は、Et であり、R ² は、Pr であり、 G は、H である。		139	R ¹ は、Et であり、R ² は、Cl であり、 G は、H である。
122	R ¹ は、Et であり、R ² は、Pr であり、 G は、C(O)-Ph である。		140	R ¹ は、Et であり、R ² は、Cl であり、 G は、C(O)-Ph である。 40
123	R ¹ は、Et であり、R ² は、Pr であり、 G は、CO ₂ Me である。		141	R ¹ は、Et であり、R ² は、Cl であり、 G は、CO ₂ Me である。
124	R ¹ は、Et であり、R ² は、Pr であり、 G は、CO ₂ Et である。		142	R ¹ は、Et であり、R ² は、Cl であり、 G は、CO ₂ Et である。
125	R ¹ は、Et であり、R ² は、Pr であり、 G は、CO ₂ -i-Pr である。		143	R ¹ は、Et であり、R ² は、Cl であり、 G は、CO ₂ -i-Pr である。

【0302】

【表 15】

表	表題行		表	表題行
144	R ¹ は、Et であり、R ² は、Cl であり、G は、CH ₂ OMe である。		162	R ¹ は、Et であり、R ² は、I であり、G は、CH ₂ OMe である。
145	R ¹ は、Et であり、R ² は、Cl であり、G は、SO ₂ Me である。		163	R ¹ は、Et であり、R ² は、I であり、G は、SO ₂ Me である。
146	R ¹ は、Et であり、R ² は、Br であり、G は、C(O)Me である。		164	R ¹ は、Et であり、R ² は、OMe であり、G は、C(O)Me である。10
147	R ¹ は、Et であり、R ² は、Br であり、G は、C(O)Et である。		165	R ¹ は、Et であり、R ² は、OMe であり、G は、C(O)Et である。
148	R ¹ は、Et であり、R ² は、Br であり、G は、H である。		166	R ¹ は、Et であり、R ² は、OMe であり、G は、H である。
149	R ¹ は、Et であり、R ² は、Br であり、G は、C(O)-Ph である。		167	R ¹ は、Et であり、R ² は、OMe であり、G は、C(O)-Ph である。
150	R ¹ は、Et であり、R ² は、Br であり、G は、CO ₂ Me である。		168	R ¹ は、Et であり、R ² は、OMe であり、G は、CO ₂ Me である。20
151	R ¹ は、Et であり、R ² は、Br であり、G は、CO ₂ Et である。		169	R ¹ は、Et であり、R ² は、OMe であり、G は、CO ₂ Et である。
152	R ¹ は、Et であり、R ² は、Br であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。		170	R ¹ は、Et であり、R ² は、OMe であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。
153	R ¹ は、Et であり、R ² は、Br であり、G は、CH ₂ OMe である。		171	R ¹ は、Et であり、R ² は、OMe であり、G は、CH ₂ OMe である。
154	R ¹ は、Et であり、R ² は、Br であり、G は、SO ₂ Me である。		172	R ¹ は、Et であり、R ² は、OMe であり、G は、SO ₂ Me である。30
155	R ¹ は、Et であり、R ² は、I であり、G は、C(O)Me である。		173	R ¹ は、Et であり、R ² は、OEt であり、G は、C(O)Me である。
156	R ¹ は、Et であり、R ² は、I であり、G は、C(O)Et である。		174	R ¹ は、Et であり、R ² は、OEt であり、G は、C(O)Et である。
157	R ¹ は、Et であり、R ² は、I であり、G は、H である。		175	R ¹ は、Et であり、R ² は、OEt であり、G は、H である。
158	R ¹ は、Et であり、R ² は、I であり、G は、C(O)-Ph である。		176	R ¹ は、Et であり、R ² は、OEt であり、G は、C(O)-Ph である。40
159	R ¹ は、Et であり、R ² は、I であり、G は、CO ₂ Me である。		177	R ¹ は、Et であり、R ² は、OEt であり、G は、CO ₂ Me である。
160	R ¹ は、Et であり、R ² は、I であり、G は、CO ₂ Et である。		178	R ¹ は、Et であり、R ² は、OEt であり、G は、CO ₂ Et である。
161	R ¹ は、Et であり、R ² は、I であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。		179	R ¹ は、Et であり、R ² は、OEt であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。

【0303】

【表 1 6】

表	表題行		表	表題行
180	R ¹ は、Et であり、R ² は、OEt であり、 G は、CH ₂ OMe である。		198	R ¹ は、Pr であり、R ² は、H であり、 G は、CH ₂ OMe である。
181	R ¹ は、Et であり、R ² は、OEt であり、 G は、SO ₂ Me である。		199	R ¹ は、Pr であり、R ² は、H であり、 G は、SO ₂ Me である。
182	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Me であり、 G は、C(O)Me である。	10	200	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Et であり、 G は、C(O)Me である。
183	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Me であり、 G は、C(O)Et である。		201	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Et であり、 G は、C(O)Et である。
184	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Me であり、 G は、H である。		202	R ¹ は、H である。
185	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Me であり、 G は、C(O)-Ph である。		203	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Et であり、 G は、C(O)-Ph である。
186	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Me であり、 G は、CO ₂ Me である。		204	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Et であり、 G は、CO ₂ Me である。
187	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Me であり、 G は、CO ₂ Et である。	20	205	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Et であり、 G は、CO ₂ Et である。
188	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Me であり、 G は、CO ₂ -i-Pr である。		206	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Et であり、 G は、CO ₂ -i-Pr である。
189	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Me であり、 G は、CH ₂ OMe である。		207	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Et であり、 G は、CH ₂ OMe である。
190	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Me であり、 G は、SO ₂ Me である。	30	208	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Pr であり、 G は、SO ₂ Me である。
191	R ¹ は、Pr であり、R ² は、H であり、 G は、C(O)Me である。		209	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Pr であり、 G は、C(O)Me である。
192	R ¹ は、Pr であり、R ² は、H であり、 G は、C(O)Et である。		210	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Pr であり、 G は、C(O)Et である。
193	R ¹ は、Pr であり、R ² は、H であり、 G は、H である。		211	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Pr であり、 G は、H である。
194	R ¹ は、Pr であり、R ² は、H であり、 G は、C(O)-Ph である。		212	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Pr であり、 G は、C(O)-Ph である。
195	R ¹ は、Pr であり、R ² は、H であり、 G は、CO ₂ Me である。	40	213	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Pr であり、 G は、CO ₂ Me である。
196	R ¹ は、Pr であり、R ² は、H であり、 G は、CO ₂ Et である。		214	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Pr であり、 G は、CO ₂ Et である。
197	R ¹ は、Pr であり、R ² は、H であり、 G は、CO ₂ -i-Pr である。		215	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Pr であり、 G は、CO ₂ -i-Pr である。

【0304】

【表 17】

表	表題行		表	表題行
216	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Pr であり、G は、CH ₂ OMe である。		234	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Cl であり、G は、CH ₂ OMe である。
217	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Pr であり、G は、SO ₂ Me である。		235	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Cl であり、G は、SO ₂ Me である。
218	R ¹ は、Pr であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、C(O)Me である。		236	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Br であり、G は、C(O)Me である。10
219	R ¹ は、Pr であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、C(O)Et である。		237	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Br であり、G は、C(O)Et である。
220	R ¹ は、Pr であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、H である。		238	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Br であり、G は、H である。
221	R ¹ は、Pr であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、C(O)-Ph である。		239	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Br であり、G は、C(O)-Ph である。
222	R ¹ は、Pr であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、CO ₂ Me である。		240	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Br であり、G は、CO ₂ Et である。20
223	R ¹ は、Pr であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、CO ₂ Et である。		241	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Br であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。
224	R ¹ は、Pr であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。		242	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Br であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。
225	R ¹ は、Pr であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、CH ₂ OMe である。		243	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Br であり、G は、CH ₂ OMe である。
226	R ¹ は、Pr であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、SO ₂ Me である。		244	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Br であり、G は、SO ₂ Me である。30
227	R ¹ は、Pr であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、C(O)Me である。		245	R ¹ は、Pr であり、R ² は、I であり、G は、C(O)Me である。
228	R ¹ は、Pr であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、C(O)Et である。		246	R ¹ は、Pr であり、R ² は、I であり、G は、C(O)Et である。
229	R ¹ は、Pr であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、H である。		247	R ¹ は、Pr であり、R ² は、I であり、G は、H である。
230	R ¹ は、Pr であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、C(O)-Ph である。		248	R ¹ は、Pr であり、R ² は、I であり、G は、C(O)-Ph である。40
231	R ¹ は、Pr であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、CO ₂ Me である。		249	R ¹ は、Pr であり、R ² は、I であり、G は、CO ₂ Et である。
232	R ¹ は、Pr であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、CO ₂ Et である。		250	R ¹ は、Pr であり、R ² は、I であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。
233	R ¹ は、Pr であり、R ² は、CF ₃ であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。		251	R ¹ は、Pr であり、R ² は、I であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。

【0305】

【表 1 8】

表	表題行	
252	R ¹ は、Pr であり、R ² は、I であり、G は、CH ₂ OMe である。	
253	R ¹ は、Pr であり、R ² は、I であり、G は、SO ₂ Me である。	
254	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OMe であり、 G は、C(O)Me である。	
255	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OMe であり、 G は、C(O)Et である。	
256	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OMe であり、 G は、H である。	
257	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OMe であり、 G は、C(O)-Ph である。	
258	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OMe であり、 G は、CO ₂ Me である。	
259	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OMe であり、 G は、CO ₂ Et である。	
260	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OMe であり、 G は、CO ₂ -i-Pr である。	
261	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OMe であり、 G は、CH ₂ OMe である。	
262	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OMe であり、 G は、SO ₂ Me である。	
263	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OEt であり、 G は、C(O)Me である。	
264	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OEt であり、 G は、C(O)Et である。	
265	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OEt であり、 G は、H である。	
266	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OEt であり、 G は、C(O)-Ph である。	
267	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OEt であり、 G は、CO ₂ Me である。	
268	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OEt であり、 G は、CO ₂ Et である。	
269	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OEt であり、 G は、CO ₂ -i-Pr である。	
270	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OEt であり、 G は、CH ₂ OMe である。	
271	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OEt であり、 G は、SO ₂ Me である。	
272	R ¹ は、プロパルギルであり、R ² は、 Me であり、G は、C(O)Me である。 10	
273	R ¹ は、プロパルギルであり、R ² は、 Me であり、G は、C(O)Et である。	
274	R ¹ は、プロパルギルであり、R ² は、 Me であり、G は、C(O)Ph である。	
275	R ¹ は、プロパルギルであり、R ² は、 Me であり、G は、H である。	
276	R ¹ は、プロパルギルであり、R ² は、 Me であり、G は、CO ₂ Me である。 20	
277	R ¹ は、プロパルギルであり、R ² は、 Me であり、G は、CO ₂ Et である。	
278	R ¹ は、プロパルギルであり、R ² は、 Me であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。	
279	R ¹ は、プロパルギルであり、R ² は、 Me であり、G は、CH ₂ OMe である。	
280	R ¹ は、プロパルギルであり、R ² は、 Me であり、G は、SO ₂ Me である。	
281	R ¹ は、アリルであり、R ² は、Me であ り、G は、C(O)Me である。 30	
282	R ¹ は、アリルであり、R ² は、Me であ り、G は、C(O)Et である。	
283	R ¹ は、アリルであり、R ² は、Me であ り、G は、CO ₂ Me である。	
284	R ¹ は、アリルであり、R ² は、Me であ り、G は、H である。	
285	R ¹ は、c-Pr であり、R ² は、Me であ り、G は、C(O)Me である。 40	
286	R ¹ は、c-Pr であり、R ² は、Me であ り、G は、C(O)Et である。	
287	R ¹ は、c-Pr であり、R ² は、Me であ り、G は、CO ₂ Me である。	

【表 1 9】

表	表題行	
288	R ¹ は、c-Pr であり、R ² は、Me であり、G は、H である。	
285	R ¹ は、Me であり、R ² は、-CN であり、G は、C(O)Me である。	
286	R ¹ は、Me であり、R ² は、-CN であり、G は、C(O)Et である。	10
287	R ¹ は、Me であり、R ² は、-CN であり、G は、CO ₂ Me である。	
288	R ¹ は、Me であり、R ² は、-CN であり、G は、H である。	

【0307】

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

【0308】

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

【0309】

固体組成物の一般的なタイプは、粉剤、粉末、粒剤、ペレット、プリル、パスタイル、錠剤、充填フィルム(種子粉衣を含む)等であり、これらは水分散性(「水和性」)または水溶性とすることができます。フィルム形成溶液または流動性懸濁液から形成されたフィルムおよびコーティングは、種子処理に特に有用である。有効成分は(マイクロ)カプセル化することができ、更に懸濁液または固体製剤に形成することができる:あるいは、有効成分の全製剤をカプセル化(または「オーバーコート」)することができる。カプセル化により、有効成分の放出の制御または遅延が可能である。乳化性粒剤は、乳剤製剤と乾燥粒状製剤の両方の利点を兼ね備える。更なる製剤の中間体として、主として高強度組成物が使用される。

【0310】

噴霧可能な製剤は、典型的には、噴霧前に適切な媒体で希釈される。このような液体および固体製剤は、通常は水であるが、場合によっては芳香族もしくはパラフィン系炭化水素または植物油のような別の適切な媒体である噴霧媒体で容易に希釈されるよう配合される。噴霧量は、ヘクタール当たり約1~数千リットルの範囲とすることができますが、より典型的には、ヘクタール当たり約10~数百リットルの範囲である。噴霧可能な製剤は、空中もしくは地上での施用による葉の処理のために、または、植物の成長培地への施用のために水または別の適切な媒体と、タンク内で混合することができる。液体および乾燥製剤は、点滴かんがいシステムに直接計量投入したり、植え付けの最中に畝間に計量投入したりできる。

【0311】

製剤は、典型的には、合計で100重量%となる以下の適切な範囲内で、有効量の有効成分、希釈剤および界面活性剤を含有する。

【0312】

【表 20】

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

【0313】

固体希釈剤には、例えば、ベントナイト、モンモリロナイト、アタパルジャイトおよびカオリンのような粘土、セッコウ、セルロース、二酸化チタン、酸化亜鉛、デンプン、デキストリン、糖類(例えば、ラクトース、スクロース)、シリカ、タルク、マイカ、ケイ藻土、尿素、炭酸カルシウム、炭酸ナトリウムおよび重炭酸ナトリウム、ならびに硫酸ナトリウムが含まれる。典型的な固体希釈剤は、Watkinsら、Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers、第2版、Dorland Books、Caldwell、New Jerseyに記載されている。20

【0314】

液体希釈剤としては、例えば、水、N,N-ジメチルアルカンアミド(例えば、N,N-ジメチルホルムアミド)、リモネン、ジメチルスルホキシド、N-アルキルピロリドン(例えば、N-メチルピロリジノン)、リン酸アルキル(例えば、リン酸トリエチル)、エチレングリコール、トリエチレングリコール、プロピレングリコール、ジプロピレングリコール、ポリプロピレングリコール、炭酸プロピレン、炭酸ブチレン、パラフィン(例えば、白色鉱油、直鎖パラフィン、イソパラフィン)、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、グリセリン、三酢酸グリセリン、ソルビトール、芳香族炭化水素、脱芳香族脂肪族化合物、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、シクロヘキサン、2-ヘプタノン、イソホロンおよび4-ヒドロキシ-4-メチル-2-ペンタノンのようなケトン、酢酸イソアミル、酢酸ヘキシリ、酢酸ヘプチル、酢酸オクチル、酢酸ノニル、酢酸トリデシルおよび酢酸イソボルニルのような酢酸エステル、アルキル化乳酸エステル、二塩基性エステル、アルキルおよびアリール安息香酸エステルおよび-ブチロラクトンのような他のエステル、ならびに、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロピルアルコール、n-ブタノール、イソブチルアルコール、n-ヘキサン、2-エチルヘキサン、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、シクロヘキサン、テトラヒドロフルフリルアルコール、ジアセトンアルコール、クレゾールおよびベンジルアルコールのような、直鎖、分枝、飽和または不飽和であるアルコールが挙げられる。液体希釈剤としては更に、植物種子油および果実油(例えば、オリーブ油、ヒマシ油、亜麻仁油、ゴマ油、コーン油(トウモロコシ油)、落花生油、ヒマワリ油、グレープシード油、サフラワー油、綿実油、ダイズ油、ナタネ油、ココナツ油およびパーム核油)、動物由来脂肪(例えば、牛脂、豚脂、ラード、タラ肝油、魚油)ならびにそれらの混合物のような飽和および不飽和脂肪酸(典型的にはC₆~C₂₂)のグリセリンエステルも挙げられる。液体希釈剤としては更に、脂肪酸が植物および動物源からのグリセリンエステルの加水分解によって得られ、蒸留によって精製可能なアルキル化脂肪酸4050

(メチル化、エチル化、ブチル化)が挙げられる。典型的な液体希釈剤は、Marsden、Solvents Guide、第2版、Interscience、New York、1950に記載されている。

【0315】

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

【0316】

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

【0317】

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

【0318】

10

20

30

40

50

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

【0319】

非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物、または非イオン性界面活性剤とカチオン性界面活性剤との混合物も、本組成物には有用である。非イオン性、アニオン性およびカチオン性界面活性剤ならびにそれらの推奨される使用については、McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, annual American and International Editions, McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 刊行；SiselyおよびWood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964；ならびに、A. S. DavidsonおよびB. Milwidsky, Synthetic Detergents, 第7版, John Wiley and Sons, New York, 1987を含む様々な公表された文献に開示されている。10

【0320】

本発明の組成物は、配合補助剤として当業者に公知である配合助剤および添加剤を更に含有してもよい（これらの一部は、固体希釈剤、液体希釈剤または界面活性剤としても機能すると考えられる）。このような配合助剤および添加剤は、以下を制御し得る：pH（緩衝液）、加工中の発泡（ポリオルガノシロキサンのような消泡剤）、有効成分の沈降（懸濁剤）、粘度（チキソトロピー増粘剤）、容器内微生物の成長（抗菌薬）、生成物の凍結（凍結防止剤）、色（染料／顔料分散剤）、洗い流し（フィルム形成剤または粘着剤）、蒸発（蒸発遅延剤）、および他の製剤属性。フィルム形成剤としては、例えば、ポリ酢酸ビニル、ポリ酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー、30
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 第2巻 : Functional Materials, annual International and North American editions, McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 刊行；およびPCT公開WO 03/024222に列挙されるものが挙げられる。30

【0321】

式1の化合物および他のいずれかの有効成分は、典型的には、有効成分を溶媒に溶解させることにより、または、液体または乾燥希釈剤中で磨碎することにより、本組成物に組み込まれる。乳剤を含む液剤は、原材料を単純に混合することにより製造することができる。乳剤としての使用が意図される液体組成物の溶媒が非水混和性である場合、乳化剤が、典型的には水での希釈時に活性含有溶媒を乳化するために添加される。2,000 μmまでの粒径を有する有効成分スラリーは、媒体ミルを使用して湿式粉碎し、平均径が3 μm未満の粒子を得ることができる。水性スラリーを最終SC剤へと加工することができる（例えば、U.S. 3,060,084を参照されたい）、または噴霧乾燥によって更に処理して顆粒水和剤を形成することができる。乾燥剤は、通常、乾式粉碎プロセスを必要とし、それにより2~10 μm範囲の平均粒径がもたらされる。粉剤および粉末は、ブレンドし、通常は磨碎（ハンマーミルまたは流体エネルギーミルなどで）することにより、製造することができる。粒剤およびペレットは、予備形成された顆粒担体上に活性材料を40
50

噴霧することにより、または凝集技法によって製造することができる。Browning、「Agglomeration」、Chemical Engineering、1967年12月4日、147~48頁、Perry's Chemical Engineer's Handbook、第4版、McGraw-Hill、New York、1963、8~57頁以降、およびWO91/13546を参照されたい。ペレットは、U.S.4,172,714に記載されているようにして製造することができる。顆粒水和剤および顆粒水溶剤は、U.S.4,144,050、U.S.3,920,442およびDE3,246,493に教示されるようにして製造することができる。錠剤は、U.S.5,180,587、U.S.5,232,701およびU.S.5,208,030に教示されるように製造することができる。フィルムは、GB2,095,558およびU.S.3,299,566に教示されるように製造することができる。10

【0322】

製剤技術に関する更なる情報に関しては、T.S.Woods、「The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture」in Pesticide Chemistry and Bioscience、The Food-Environment Challenge、T.BrooksおよびT.R.Roberts編、Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry、The Royal Society of Chemistry、Cambridge、1999、120~133頁を参照されたい。更に、20
U.S.3,235,361、6欄16行~7欄19行および実施例10~41；U.S.3,309,192、5欄43行~7欄62行ならびに実施例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138~140、162~164、166、167および169~182；U.S.2,891,855、3欄66行~5欄17行および実施例1~4；Klingman、Weed Control as a Science、John Wiley and Sons, Inc.、New York、1961、81~96頁；Hanceら、Weed Control Handbook、第8版、Blackwell Scientific Publications、Oxford、1989；およびDevelopments in formulation technology、PJB Publications、Richmond、UK、200030を参照されたい。

【0323】

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

【0324】

【表21】

実施例A

高強度濃縮物

化合物1	98.5%
シリカエアロゲル	0.5%
合成非晶質微細シリカ	1.0%

【0325】

【表 2 2】

実施例 B水和剤

化合物1	65.0%	
ドデシルフェノールポリエチレングリコールエーテル	2.0%	
リグニンスルホン酸ナトリウム	4.0%	
アルミノケイ酸ナトリウム	6.0%	
モンモリロナイト(か焼)	23.0%	10

【0 3 2 6】

【表 2 3】

実施例 C粒剤

化合物1	10.0%	
アタパルジヤイト顆粒(低揮発性物質、 0.71/0.30mm;U.S.S.No.25-50篩)	90.0%	
		20

【0 3 2 7】

【表 2 4】

実施例 D押出ペレット

化合物1	25.0%	
無水硫酸ナトリウム	10.0%	
粗リグニンスルホン酸カルシウム	5.0%	30
アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム	1.0%	
カルシウム/マグネシウムベントナイト	59.0%	

【0 3 2 8】

【表 2 5】

実施例 E乳剤

化合物1	10.0%	40
ヘキサオレイン酸ポリオキシエチレンソルビトール	20.0%	
C ₆ ～C ₁₀ 脂肪酸メチルエステル	70.0%	

【0 3 2 9】

【表 2 6】

実施例 Fマイクロエマルション

化合物1	5.0%	
ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー	30.0%	
アルキルポリグリコシド	30.0%	
モノオレイン酸グリセリル	15.0%	
水	20.0%	10

【0 3 3 0】

【表 2 7】

実施例 GSC 剤

化合物1	35%	
ブチルポリオキシエチレン/ポリプロピレンブロックコポリマー	4.0%	
ステアリン酸/ポリエチレングリコールコポリマー	1.0%	20
スチレンアクリルポリマー	1.0%	
キサンタンガム	0.1%	
プロピレングリコール	5.0%	
シリコーン系消泡剤	0.1%	
1,2-ベンゾイソチアゾリン-3-オン	0.1%	
水	53.7%	

【0 3 3 1】

【表 2 8】

実施例 H水中エマルション

化合物1	10.0%	
ブチルポリオキシエチレン/ポリプロピレンブロックコポリマー	4.0%	
ステアリン酸/ポリエチレングリコールコポリマー	1.0%	
スチレンアクリルポリマー	1.0%	40
キサンタンガム	0.1%	
プロピレングリコール	5.0%	
シリコーン系消泡剤	0.1%	
1,2-ベンゾイソチアゾリン-3-オン	0.1%	
芳香族石油系炭化水素	20.0	
水	58.7%	

【0 3 3 2】

【表 29】

実施例 I油分散液

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

10

【0333】

本開示は、「化合物1」を「化合物2」、「化合物3」、「化合物4」、「化合物5」、「化合物6」、「化合物7」、「化合物8」、「化合物9」、「化合物10」、「化合物11」、「化合物12」、「化合物13」、「化合物14」、「化合物15」、「化合物16」、「化合物17」、「化合物18」、「化合物19」、「化合物20」、「化合物21」、「化合物22」、「化合物23」、「化合物24」、「化合物25」、「化合物26」、「化合物27」、「化合物28」、「化合物29」、「化合物30」、「化合物31」、「化合物32」、「化合物33」、「化合物34」、「化合物35」、「化合物36」、「化合物37」、「化合物38」、「化合物39」、「化合物40」、「化合物41」、「化合物42」、「化合物43」、「化合物44」、「化合物45」、「化合物46」、「化合物47」、「化合物48」、「化合物49」、「化合物50」、「化合物51」、「化合物52」、「化合物53」、「化合物54」、「化合物55」、「化合物56」、「化合物57」、「化合物58」、「化合物59」、「化合物60」、「化合物61」、「化合物62」、「化合物63」、「化合物64」、「化合物65」、「化合物66」、「化合物67」、「化合物68」、「化合物69」、「化合物70」、「化合物71」または「化合物72」に置き換えたことを除き、上記例A～Iを更に含む。

20

【0334】

試験結果は、本発明の化合物が、活性が高度な発生前処理除草剤および／または発生後処理除草剤および／または植物成長調節剤であることを示している。本発明の化合物は一般的に、発生後雑草防除（即ち、土壤から雑草の実生が出現した後に施用）および発生前雑草防除（即ち、土壤から雑草の実生が出現する前に施用）の場合に最も高い活性を示す。その多くは、燃料保管タンクの周囲、産業用保管領域、駐車場、ドライブインシアター、飛行場、河岸、灌漑用および他の水路、広告板の周囲、ならびに、幹線道路および鉄道構造物のような、全ての植生の完全な防除が望まれる領域における広範囲の発生前および／または発生後雑草防除について実用性を有する。本発明の化合物の多くは、農作物対雑草における選択性的な代謝のため、または、農作物および雑草における生理的阻害位置における選択性により、または、農作物と雑草の混合物の環境上または内の選択性配置により、農作物／雑草混合物中における草および広葉雑草の選択性的な防除に有用である。当業者であれば認識することであるが、化合物または化合物群におけるこれらの選択性要因の好適な組合せは、慣例的な生物学的および／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。本発明の化合物は、アルファアルファ、オオムギ、ワタ、コムギ、セイヨウアブラナ、サトウダイコン、コーン（トウモロコシ）、ソルガム、ダイズ、イネ、オートムギ、ピーナッツ、野菜、トマト、ジャガイモ、コーヒー、カカオ、アブラヤシ、ゴム、サトウキビ、柑橘類、ブドウ、果樹、堅果樹、バナナ、プランテン、パイナップル、ホップ、茶を含む多年生プランテーション農作物、ならびにユーカリおよび針葉樹（例えば、テーダマツ）のような森林、および芝生種（例えば、ケンタッキーブルーグラス、アメリカシバ、ケンタッキーフェスキューおよびギョウギシバ）を含むが、これに限定されない重要な普通農作物に対して耐性を示し得る。本発明の化合物は、遺伝子組換えまたは交配により除草剤に対する耐性が組み込まれ、無脊椎動物有害生物に対して毒性のあるタンパク質（バチルス・チューリングンシス（Bacillus thur

30

40

50

ingiensis) 毒素など) を発現し、および / または、他の有用な形質を発現する農作物に用いることが可能である。当業者であれば理解することであるが、当業者は、全ての化合物が全ての雑草に対して等しく効果的であるわけではない。代わりに、本化合物は、植物の成長を改変するのに有用である。

【 0 3 3 5 】

本発明の化合物は、発生前処理除草活性および発生後処理除草活性を共に有しているため、植生を死滅させる、または植生に損傷を与える、または、その成長を抑制することにより望ましくない植生を防除するには、化合物を、本発明の化合物または前記化合物と界面活性剤、固体希釈剤もしくは液体希釈剤のうちの少なくとも 1 種を含む組成物の除草有効量を、望ましくない植生の群葉もしくは他の部分に、または、望ましくない植生が成長している土壌もしくは水、または望ましくない植生の種子もしくは他の珠芽の周囲の土壌もしくは水のような望ましくない植生の環境に接触させることを含む多様な方法により有用に施用することができる。10

【 0 3 3 6 】

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

【 0 3 3 7 】

一般的な実施形態において、本発明の化合物は、典型的には組成物に配合され、所望の植生(例えば農作物)および望ましくない植生(即ち雑草)(これらは共に、種子、実生および / またはより成長した植物の場合がある)を含む生息地に対し、成長培地(例えば土壌)に接触させて施用される。この生息地において、本発明の化合物を含む組成物は、特に望ましくない植生の植物もしくはその一部に対し、および / または、植物に接触している成長培地に対し、直接施用することが可能である。20

【 0 3 3 8 】

本発明の化合物で処理された生息地における所望の植生の植物の変種および栽培変種は、従来の繁殖および交配方法により、または、遺伝子操作法により得ることが可能である。遺伝子操作された植物(遺伝子組換え植物)は、異種遺伝子(導入遺伝子)が植物のゲノムに安定的に組み込まれたものである。植物ゲノムにおける特定の位置により定義される導入遺伝子は、形質転換または遺伝子組換えイベントと呼ばれる。30

【 0 3 3 9 】

本発明に従い処理可能な生息地における遺伝子操作された植物栽培変種は、1つまたはそれ以上の生物ストレス(線虫、昆虫、ダニ、菌類などのような有害生物)もしくは非生物ストレス(渴水、低温、土壤塩分など)に対して耐性があるもの、または他の望ましい特性を含有するものを含む。植物は、遺伝子操作されて、例えば、除草剤耐性、虫害抵抗性、変性油プロファイルまたは渴水耐性といった形質を示すことが可能である。単一の遺伝子形質転換イベントまたは形質転換イベントの組合せを含有する有用な遺伝子操作された植物が提示 C に列挙されている。提示 C に列挙されている遺伝子組換えについての追加情報は、例えば米国農務省によって管理された公に利用可能なデータベースから入手可能である。40

【 0 3 4 0 】

以下の略語 T 1 ~ T 3 7 が形質に関して提示 C において用いられている。ハイフン「 - 」はその項目が利用不可であることを意味し、「 tol . 」は「耐性」を意味し、「 res . 」は抵抗性を意味する。

【 0 3 4 1 】

【表 3 0】

形質	記載	形質	記載	形質	記載
T1	グリホサート耐性	T15	冷温耐性	T27	高トリプトファン
T2	高ラウリン酸油	T16	イミダゾリノン除草剤耐性	T28	直立葉半矮性
T3	グルホシネート耐性	T17	変性 α -アミラーゼ	T29	半矮性
T4	フィチン酸分解	T18	受粉制御	T30	低鉄耐性
T5	オキシニル耐性	T19	2,4-D 耐性	T31	変性油/脂肪酸
T6	病害抵抗性	T20	リシン增加	T32	HPPD 耐性
T7	昆虫抵抗性	T21	渴水耐性	T33	高油分
T9	花の変色	T22	遅延成熟/老化	T34	アリールオキシアルカノアート耐性
T11	ALS 除草剤耐性	T23	製品品質改良	T35	メソトリオン耐性
T12	ジカンバ耐性	T24	高セルロース	T36	ニコチン低下
T13	抗アレルギー	T25	改質デンプン/炭水化物	T37	産物変性
T14	塩耐性	T26	昆虫&病害抵抗性		

【0 3 4 2】

【表 3 1】

農作物	イベント名称	提示 C		遺伝子
		イベントコード	形質	
アルファルファ	J101	MON-00101-8	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
アルファルファ	J163	MON-ØØ163-7	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
キヤノーラ*	23-18-17 (イベント18)	CGN-89465-2	T2	te
キヤノーラ*	23-198 (イベント23)	CGN-89465-2	T2	te
キヤノーラ*	61061	DP-Ø61Ø61-7	T1	gat4621
キヤノーラ*	73496	DP-Ø73496-4	T1	gat4621
キヤノーラ*	GT200 (RT200)	MON-89249-2	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
キヤノーラ*	GT73 (RT73)	MON-ØØØ73-7	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
キヤノーラ*	HCN10 (Topas 19/2)	-	T3	bar
キヤノーラ*	HCN28 (T45)	ACS-BNØØ8-2	T3	pat (syn)
キヤノーラ*	HCN92 (Topas 19/2)	ACS-BNØØ7-1	T3	bar
キヤノーラ*	MON88302	MON-883Ø2-9	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
キヤノーラ*	MPS961	-	T4	phyA
キヤノーラ*	MPS962	-	T4	phyA
キヤノーラ*	MPS963	-	T4	phyA
キヤノーラ*	MPS964	-	T4	phyA
キヤノーラ*	MPS965	-	T4	phyA
キヤノーラ*	MS1 (B91-4)	ACS-BNØØ4-7	T3	bar
キヤノーラ*	MS8	ACS-BNØØ5-8	T3	bar
キヤノーラ*	OXY-235	ACS-BNØ11-5	T5	bxn
キヤノーラ*	PHY14	-	T3	bar
キヤノーラ*	PHY23	-	T3	bar
キヤノーラ*	PHY35	-	T3	bar
キヤノーラ*	PHY36	-	T3	bar
キヤノーラ*	RF1 (B93-101)	ACS-BNØØ1-4	T3	bar
キヤノーラ*	RF2 (B94-2)	ACS-BNØØ2-5	T3	bar
キヤノーラ*	RF3	ACS-BNØØ3-6	T3	bar
ビーン	EMBRAPA 5.1	EMB-PV051-1	T6	ac1 (センスおよび アンチセンス)
プリンジャル#	EE-1	-	T7	cry1Ac
ワタ	19-51a	DD-Ø1951A-7	T11	S4-HrA
ワタ	281-24-236	DAS-24236-5	T3,T7	pat (syn); cry1F
ワタ	3006-210-23	DAS-21Ø23-5	T3,T7	pat (syn); cry1Ac
ワタ	31707	-	T5,T7	bxn; cry1Ac
ワタ	31803	-	T5,T7	bxn; cry1Ac
ワタ	31807	-	T5,T7	bxn; cry1Ac
ワタ	31808	-	T5,T7	bxn; cry1Ac

【0 3 4 3】

【表 3 2】

ワタ	42317	-	T5,T7	bxn; cry1Ac	
ワタ	BNLA-601	-	T7	cry1Ac	
ワタ	BXN10211	BXN10211-9	T5	bxn; cry1Ac	
ワタ	BXN10215	BXN10215-4	T5	bxn; cry1Ac	
ワタ	BXN10222	BXN10222-2	T5	bxn; cry1Ac	
ワタ	BXN10224	BXN10224-4	T5	bxn; cry1Ac	
ワタ	COT102	SYN-IR102-7	T7	vip3A(a)	10
ワタ	COT67B	SYN-IR67B-1	T7	cry1Ab	
ワタ	COT202	-	T7	vip3A	
ワタ	イベント1	-	T7	cry1Ac	
ワタ	GMF Cry1A	GTL-GMF311-7	T7	cry1Ab-Ac	
ワタ	GHB119	BCS-GH005-8	T7	cry2Ae	
ワタ	GHB614	BCS-GH002-5	T1	2mepsps	
ワタ	GK12	-	T7	cry1Ab-Ac	
ワタ	LLCotton25	ACS-GH001-3	T3	bar	
ワタ	MLS 9124	-	T7	cry1C	20
ワタ	MON1076	MON-89924-2	T7	cry1Ac	
ワタ	MON1445	MON-01445-2	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
ワタ	MON15985	MON-15985-7	T7	cry1Ac; cry2Ab2	
ワタ	MON1698	MON-89383-1	T7	cp4 epsps (aroA:CP4)	
ワタ	MON531	MON-00531-6	T7	cry1Ac	
ワタ	MON757	MON-00757-7	T7	cry1Ac	
ワタ	MON88913	MON-88913-8	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
ワタ	Nqwe Chi 6 Bt	-	T7	-	
ワタ	SKG321	-	T7	cry1A; CpTI	30
ワタ	T303-3	BCS-GH003-6	T3,T7	cry1Ab; bar	
ワタ	T304-40	BCS-GH004-7	T3,T7	cry1Ab; bar	
ワタ	CE43-67B	-	T7	cry1Ab	
ワタ	CE46-02A	-	T7	cry1Ab	
ワタ	CE44-69D	-	T7	cry1Ab	
ワタ	1143-14A	-	T7	cry1Ab	
ワタ	1143-51B	-	T7	cry1Ab	
ワタ	T342-142	-	T7	cry1Ab	
ワタ	PV-GHGT07 (1445)	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	40
ワタ	EE-GH3	-	T1	mepsps	
ワタ	EE-GH5	-	T7	cry1Ab	
ワタ	MON88701	MON-88701-3	T3,T12	組換え dmo; bar	
ワタ	OsCr11	-	T13	組換え Cry j	
アマ	FP967	CDC-FL001-2	T11	als	
レンチル	RH44	-	T16	als	
トウモロコシ	3272	SYN-E3272-5	T17	amy797E	

【表 3 3】

トウモロコシ	5307	SYN-05307-1	T7	ecry3.1Ab	
トウモロコシ	59122	DAS-59122-7	T3,T7	cry34Ab1; cry35Ab1; pat	
トウモロコシ	676	PH-000676-7	T3,T18	pat; dam	
トウモロコシ	678	PH-000678-9	T3,T18	pat; dam	
トウモロコシ	680	PH-000680-2	T3,T18	pat; dam	
トウモロコシ	98140	DP-098140-6	T1,T11	gat4621; zm-hra	
トウモロコシ	Bt10	-	T3,T7	cry1Ab; pat	10
トウモロコシ	Bt176 (176)	SYN-EV176-9	T3,T7	cry1Ab; bar	
トウモロコシ	BVLA430101	-	T4	phyA2	
トウモロコシ	CBH-351	ACS-ZM004-3	T3,T7	cry9C; bar	
トウモロコシ	DAS40278-9	DAS40278-9	T19	aad-1	
トウモロコシ	DBT418	DKB-89614-9	T3,T7	cry1Ac; pinII; bar	
トウモロコシ	DLL25 (B16)	DKB-89790-5	T3	bar	
トウモロコシ	GA21	MON-00021-9	T1	mepsps	
トウモロコシ	GG25	-	T1	mepsps	
トウモロコシ	GJ11	-	T1	mepsps	20
トウモロコシ	Fl117	-	T1	mepsps	
トウモロコシ	GAT-ZM1	-	T3	pat	
トウモロコシ	LY038	REN-00038-3	T20	cordapA	
トウモロコシ	MIR162	SYN-IR162-4	T7	vip3Aa20	
トウモロコシ	MIR604	SYN-IR604-5	T7	mcry3A	
トウモロコシ	MON801 (MON80100)	MON801	T1,T7	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON802	MON-80200-7	T1,T7	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON809	PH-MON-809-2	T1,T7	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	30
トウモロコシ	MON810	MON-00810-6	T1,T7	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON832	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON863	MON-00863-5	T7	cry3Bb1	
トウモロコシ	MON87427	MON-87427-7	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
トウモロコシ	MON87460	MON-87460-4	T21	cspB	
トウモロコシ	MON88017	MON-88017-3	T1,T7	cry3Bb1; cp4 epsps (aroA:CP4)	
トウモロコシ	MON89034	MON-89034-3	T7	cry2Ab2; cry1A.105	
トウモロコシ	MS3	ACS-ZM001-9	T3,T18	bar; barnase	40
トウモロコシ	MS6	ACS-ZM005-4	T3,T18	bar; barnase	
トウモロコシ	NK603	MON-00603-6	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
トウモロコシ	T14	ACS-ZM002-1	T3	pat (syn)	
トウモロコシ	T25	ACS-ZM003-2	T3	pat (syn)	
トウモロコシ	TC1507	DAS-01507-1	T3,T7	cry1Fa2; pat	
トウモロコシ	TC6275	DAS-06275-8	T3,T7	mcry1F; bar	
トウモロコシ	VIP1034	-	T3,T7	vip3A; pat	

【表 3 4】

トウモロコシ	43A47	DP-043A47-3	T3,T7	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
トウモロコシ	40416	DP-040416-8	T3,T7	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
トウモロコシ	32316	DP-032316-8	T3,T7	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
トウモロコシ	4114	DP-004114-3	T3,T7	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
メロン	メロン A	-	T22	sam-k
メロン	メロン B	-	T22	sam-k
パパイヤ	55-1	CUH-CP551-8	T6	prsv cp
パパイヤ	63-1	CUH-CP631-7	T6	prsv cp
パパイヤ	Huanong No. 1	-	T6	prsv rep
パパイヤ	XI7-2	UFL-X17CP-6	T6	prsv cp
プラム	C-5	ARS-PLMCS-6	T6	ppv cp
キャノーラ**	ZSR500	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
キャノーラ**	ZSR502	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
キャノーラ**	ZSR503	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
イネ	7Crp#242-95-7	-	T13	7crp
イネ	7Crp#10	-	T13	7crp
イネ	GM Shanyou 63	-	T7	cry1Ab; cry1Ac
イネ	Huahui-1/TT51-1	-	T7	cry1Ab; cry1Ac
イネ	LLRICE06	ACS-OS001-4	T3	bar
イネ	LLRICE601	BCS-OS003-7	T3	bar
イネ	LLRICE62	ACS-OS002-5	T3	bar
イネ	Tarom molaii + cry1Ab	-	T7	cry1Ab (切断型)
イネ	GAT-OS2	-	T3	bar
イネ	GAT-OS3	-	T3	bar
イネ	PE-7	-	T7	Cry1Ac
イネ	7Crp#10	-	T13	7crp
イネ	KPD627-8	-	T27	OASA1D
イネ	KPD722-4	-	T27	OASA1D
イネ	KA317	-	T27	OASA1D
イネ	HW5	-	T27	OASA1D
イネ	HW1	-	T27	OASA1D
イネ	B-4-1-18	-	T28	Δ OsBRI1
イネ	G-3-3-22	-	T29	OSGA2ox1
イネ	AD77	-	T6	DEF
イネ	AD51	-	T6	DEF
イネ	AD48	-	T6	DEF
イネ	AD41	-	T6	DEF
イネ	13pNasNa800725atAprt1	-	T30	HvNAS1; HvNAAT-A; APRT

【 0 3 4 6 】

【表35】

イネ	13pAprt1	-	T30	APRT HvNAS1; HvNAAT-A; HvNAAT-B HvIDS3
イネ	gHvNAS1-gHvNAAT-1	-	T30	HvNAAT-A; HvNAAT-B
イネ	gHvIDS3-1	-	T30	HvNAAT-A; HvNAAT-B
イネ	gHvNAAT1	-	T30	HvNAS1
イネ	gHvNAS1-1	-	T30	WRKY45
イネ	NIA-OS006-4	-	T6	WRKY45
イネ	NIA-OS005-3	-	T6	WRKY45
イネ	NIA-OS004-2	-	T6	WRKY45
イネ	NIA-OS003-1	-	T6	WRKY45
イネ	NIA-OS002-9	-	T6	WRKY45
イネ	NIA-OS001-8	-	T6	WRKY45
イネ	OsCr11	-	T13	組換え Cry j
イネ	17053	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
イネ	17314	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
バラ	WKS82 / 130-4-1	IFD-52401-4	T9	5SAT; bp40 (f3'5'h)
バラ	WKS92 / 130-9-1	IFD-52901-9	T9	5SAT; bp40 (f3'5'h)
ダイズ	260-05 (G94-1, G94-19, G168)	-	T9	gm-fad2-1 (遺伝子座 のサイレンシング)
ダイズ	A2704-12	ACS-GM005-3	T3	pat
ダイズ	A2704-21	ACS-GM004-2	T3	pat
ダイズ	A5547-127	ACS-GM006-4	T3	pat
ダイズ	A5547-35	ACS-GM008-6	T3	pat
ダイズ	CV127	BPS-CV127-9	T16	csr1-2
ダイズ	DAS68416-4	DAS68416-4	T3	pat
ダイズ	DP305423	DP-305423-1	T11,T31	gm-fad2-1 (遺伝子座 のサイレンシング); gm-hra
ダイズ	DP356043	DP-356043-5	T1,T31	gm-fad2-1 (遺伝子座 のサイレンシング); gat4601
ダイズ	FG72	MST-FG072-3	T32,T1	2mepsps; hppdPF W336
ダイズ	GTS 40-3-2 (40-3-2)	MON-04032-6	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
ダイズ	GU262	ACS-GM003-1	T3	pat
ダイズ	MON87701	MON-87701-2	T7	cry1Ac
ダイズ	MON87705	MON-87705-6	T1,T31	fatb1-A (センス&ア ンチセンス); fad2-1A (センス&アンチセン ス); cp4 epsps (aroA:CP4)
ダイズ	MON87708	MON-87708-9	T1,T12	dmo; cp4 epsps (aroA:CP4)
ダイズ	MON87769	MON-87769-7	T1,T31	Pj.D6D; Nc.Fad3; cp4 epsps (aroA:CP4)
ダイズ	MON89788	MON-89788-1	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)

【表36】

ダイズ	W62	ACS-GM002-9	T3	bar	
ダイズ	W98	ACS-GM001-8	T3	bar	
ダイズ	MON87754	MON-87754-1	T33	dgat2A	
ダイズ	DAS21606	DAS-21606	T34,T3	組換え-12; pat	
ダイズ	DAS44406	DAS-44406-6	T1,T3,T34	組換え-12; 2mepsps; pat	
ダイズ	SYHT04R	SYN-0004R-8	T35	組換え avhppd	
ダイズ	9582.814.19.1	-	T3,T7	cry1Ac, cry1F, PAT cmv cp, zymv cp, wmv cp	10
カボチャ	CZW3	SEM-0CZW3-2	T6	zymv cp, wmv cp	
カボチャ	ZW20	SEM-0ZW20-7	T6	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
サトウダイコン	GTSB77 (T9100152)	SY-GTSB77-8	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
サトウダイコン	H7-1	KM-000H71-4	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
サトウダイコン	T120-7	ACS-BV001-3	T3	pat	
サトウダイコン	T227-1	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
サトウキビ	NXI-1T	-	T21	EcbetA	
ヒマワリ	X81359	-	T16	als	
コショウ	PK-SP01	-	T6	cmv cp	20
タバコ	C/F/93/08-02	-	T5	bxn	
タバコ	Vector 21-41	-	T36	NtQPT1 (アンチセン ス)	
ヒマワリ	X81359	-	T16	als	
コムギ	MON71800	MON-71800-3	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	

* アルゼンチン産(ブロッサ・ナップス(*Brassica napus*))、**ポーランド産(ブロッサ・ラバ(*B.rapa*))、#ナス

【0348】

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

【0349】

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

30

40

50

は活性剤を式 1 の化合物とは別に配合し、製剤を施用前に（例えば、噴霧タンク中で）混ぜ合わせるか、もしくは、交互に連續して施用したりすることが可能である。

【 0 3 5 0 】

以下の除草剤の 1 種またはそれ以上と本発明の化合物との混合物が、雑草防除に特に有用となり得る：アセトクロール、アシフルオルフェンおよびそのナトリウム塩、アクロニフェン、アクロレイン（2 - プロペナール）、アラクロール、アロキシジム、アメトリン、アミカルバゾン、アミドスルフロン、アミノシクロピラクロルおよびそのエステル（例えば、メチル、エチル）および塩（例えば、ナトリウム、カリウム）、アミノピラリド、アミトロール、スルファミン酸アンモニウム、アニロホス、アシュラム、アトラジン、アジムスルフロン、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、ベンタゾン、ベンゾビシクロロン、ベンゾフェナップ、ビシクロピロン、ビフェノックス、ビラナホス、ビスピリバッカおよびそのナトリウム塩、プロマシル、プロモブチド、プロモフェノキシム、プロモキシニル、オクタン酸プロモキシニル、ブタクロール、ブタフェナシル、ブタミホス、ブトラリン、ブトロキシジム、ブチレート、カフェンストロール、カルベタミド、カルフェントラゾン - エチル、カテキン、クロメトキシフェン、クロラムベン、クロルプロムロン、クロルフルレノール - メチル、クロリダゾン、クロリムロン - エチル、クロロトルロン、クロルプロファム、クロルスルフロン、クロルタール - ジメチル、クロルチアミド、シニドン - エチル、シンメシリソ、シノスルフロン、クラシホス、クレホキシジム、クレトジム、クロジナホップ - プロバルギル、クロマゾン、クロメプロップ、クロピラリド、クロピラリド - オラミン、クロランスラム - メチル、クミルロン、シアナジン、シクロエート、シクロピリモレート、シクロスルファムロン、シクロキシジム、シハロホップ - ブチル、2 , 4 - D およびそのブトチル、ブチル、イソオクチルおよびイソプロピルエステルおよびそのジメチルアンモニウム、ジオラミンおよびトロラミン塩、ダイムロン、ダラポン、ダラポン - 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、デスマディファム、デスマトリソ、ジカンバおよびそのジグリコールアンモニウム、ジメチルアンモニウム、カリウムおよびナトリウム塩、ジクロベニル、ジクロルプロップ、ジクロホップ - メチル、ジクロスラム、メチル硫酸ジフェンゾコート、ジフルフェニカン、ジフルフェンゾピル、ジメフロン、ジメビペレート、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、ジメチビン、ジメチルアルシン酸およびそのナトリウム塩、ジニトロアミン、ジノテルブ、ジフェナミド、ジクワットジプロミド、ジチオピル、ジウロン、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、フェノキサスルホン、フェンキノトリオン、フェントラザミド、フェヌロン、フェヌロン - 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、フルアゾレート、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、フルフェンピル、フルフェンピル - エチル、フルメツラム、フルミクロラック - ペンチル、フルミオキサジン、フルオメツロン、フルオログリコフェン - エチル、フルポキサム、フルピルスルフロン - 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、フルロキシピル、フルルタモン、フルチアセット - メチル、フォメサフェン、ホラムスルフロン、ホサミン - アンモニウム、グルホシネット、グルホシネット - アンモニウム、グルホシネット - P、アンモニウム、イソプロピルアンモニウム、カリウム、ナトリウム（セスキナトリウムを含む）およびトリメシウム（代替的にスルホサートとも呼ばれる）のような、グリホサートおよびその塩、ハラウキシフェン、ハラウキシフェン - メチル、ハロスルフロン - メチル、ハロキシホップ - エトチル、ハロキシホップ - メチル、ヘキサジノン、ヒダントシジン、イマザメタベンズ - メチル、イマザモックス、イマザピク、イマザピル、イマザキン、イマザキン - アンモニウム、イマゼ

10

20

30

40

50

タピル、イマゼタピル - アンモニウム、イマゾスルフロン、インダノファン、インダジフラム、イオフェンスルフロン、ヨードスルフロン - メチル、アイオキシニル、オクタン酸アイオキシニル、アイオキシニル - ナトリウム、イプフェンカルバゾン、イソプロツロン、イソウロン、イソキサベン、イソキサフルトール、イソキサクロルトール、ラクトフェン、レナシル、リニュロン、マレイン酸ヒドラジド、M C P A およびその塩（例えば、M C P A - ジメチルアンモニウム、M C P A - カリウムおよびM C P A - ナトリウム、エステル（例えば、M C P A - 2 - エチルヘキシル、M C P A - ブトチル）およびチオエステル（例えば、M C P A - チオエチル）、M C P B およびその塩（例えば、M C P B - ナトリウム）およびエステル（例えば、M C P B - エチル）、メコプロップ、メコプロップ - P、メフェンアセト、メフルイジド、メソスルフロン - メチル、メソトリオン、メタム - ナトリウム、メタミホップ、メタミトロン、メタザクロル、メタゾスルフロン、メタベンズチアズロン、メチルアルソン酸およびそのカルシウム、一アンモニウム、一ナトリウムおよび二ナトリウム塩、メチルジムロン、メトベンズロン、メトプロムロン、メトラクロル、S - メトラクロル、メトラクロン、メトキスロン、メトリブジン、メトスルフロン - メチル、モリネート、モノリヌロン、ナプロアニリド、ナプロップアミド、ナプロップアミド - M、ナブタラム、ネブロン、ニコスルフロン、ノルフルラゾン、オルベンカルブ、オルトスルファムロン、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、オキサジクロメホン、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、ベンジメタリン、ペノキススラム、ペントナクロル、ペントキサゾン、ペルフルイドン、ペトキサミド、ペトキシアミド、フェンメジファム、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、ピペロホース、プレチラクロル、ブリミスルフロン - メチル、プロジェクトアミン、プロホキシジム、プロメトン、プロメトリン、プロパクロル、プロパニル、プロパキザホップ、プロバジン、プロファム、プロピソクロル、プロポキシカルバゾン、プロピリスルフロン、プロピズアミド、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、ピラゾリネット、ピラゾキシフェン、ピラゾスルフロン - エチル、ピリベンゾオキシム、ピリブチカルブ、ピリデート、ピリフタリド、ピリミノバク - メチル、ピリミスルファン、ピリチオバク、ピリチオバク - ナトリウム、ピロキサスルホン、ピロキシスラム、キンクロラク、キンメラク、キノクラミン、キザロホップ - エチル、キザロホップ - P - エチル、キザロホップ - P - テフリル、リムスルフロン、サフルフェナシル、セトキシジム、シズロン、シマジン、シメトリン、スルコトリオン、スルフェントラゾン、スルホメツロン - メチル、スルホスルフロン、2 , 3 , 6 - T B A 、T C A 、T C A - ナトリウム、トブタム、トブチウロン、テフリルトリオン、テンボトリオン、テプラロキシジム、テルバシル、テルブメトン、テルブチルアジン、テルブトリン、テニルクロル、チアゾピル、チエンカルバゾン、チフェンスルフロン - メチル、チオベンカルブ、チアフェナシル、チオカルバジル、トルピラレート、トプラメゾン、トラルコキシジム、トリ - アレート、トリアファモン、トリアスルフロン、トリアジフラム、トリベヌロン - メチル、トリクロビル、トリクロビル - ブトチル、トリクロビル - 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、トリフルジモキサジン、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、ベルノレート、3 - (2 - クロロ - 3 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 1 , 5 - ナフチリジン - 2 (1 H) - オン、5 - クロロ - 3 - [(2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル) カルボニル] - 1 - (4 - メトキシフェニル) - 2 (1 H) - キノキサリノン、2 - クロロ - N - (1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジンカルボキサミド、7 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - ピリジニル) - 5 - (2 , 2 - ジフルオロエチル) - 8 - ヒドロキシピリド [2 , 3 - b] ピラジン - 6 (5 H) - オン) 、4 - (2 , 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノン) 、5 - [[(2 , 6 - ジフルオロフェニル) メトキシ] メチル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 5 - メチル - 3 - (3 - メチル - 2 - チエニル) イソオキサゾール（以前はメチオキソリン）、4 - (4 - フルオロフェニル) - 10
20
30
40
50

6 - [(2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル) カルボニル] - 2 - メチル - 1 , 2 , 4 - トリアジン - 3 , 5 (2 H , 4 H) - ジオン、メチル 4 - アミノ - 3 - クロロ - 6 - (4 - クロロ - 2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) - 5 - フルオロ - 2 - ピリジンカルボキシレート、2 - メチル - 3 - (メチルスルホニル) - N - (1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミドおよび 2 - メチル - N - (4 - メチル - 1 , 2 , 5 - オキサジアゾール - 3 - イル) - 3 - (メチルスルフィニル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド。その他の除草剤としては、アルテルナリア・デストルエンス・シモンズ (*Alternaria destruens Simmons*)、コレトトリカム・グロエオスポリオドズ (*Coleotrichum gloeosporioides*) (Penz.) Penz. & Sacc.、ドレシュイエラ・モノセラス (*Drechsiera monoceras*) (MTB-951)、ミロテシウム・ベルカリア (*Myrothecium verrucaria*) (Albertini & Schweinitz) Ditmar: Fries、フィトフトラ・パルミボラ (*Phytophthora palmivora*) (Butl.) Butl. および プッシニア・テラスペオス (*Puccinia thlaspeos Schub.*) などの生物除草剤も挙げられる。

【0351】

本発明の化合物は更に、アビグリシン、N - (フェニルメチル) - 1 H - 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、ナトリウムニトロフェノラートおよびトリネキサパック - メチル、ならびに、バチルス・セレウス (*Bacillus cereus*) 菌株 BP01 のような植物の成長を改変する生体などの植物成長調節剤と組み合わせて用いることが可能である。

【0352】

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

【0353】

これらの様々な混合パートナーの1種またはそれ以上が用いられる実施形態について、混合パートナーは、典型的には、混合物パートナーが単独で使用される場合に慣例となっている量と同様の量で使用される。より詳細には、混合物において、有効成分は多くの場合、製品のラベルに有効成分を単独で用いる場合に指定されている施用量の半分から全量の施用量で施用される。これらの量は、The Pesticide Manual、および、The Biopesticide Manualなどの参考文献に列挙されている。式1の化合物に対するこれらの様々な混合パートナー（合計）の重量比は、典型的には、約 1 : 3 0 0 0 と約 3 0 0 0 : 1 の間である。注目すべきは、約 1 : 3 0 0 と約 3 0 0 : 1 の間の重量比（例えば、約 1 : 3 0 と約 3 0 : 1 の間の比）である。当業者は、所望の範囲の生物学的活性に必要な有効成分の生物学的有効量を単純な実験を通して容易に判定することが可能である。これらの追加の成分を包含することで、防除される雑草の範囲を、式1の化合物単独で防除される範囲を超えて拡大し得ることが明らかである。

【0354】

場合によっては、本発明の化合物と他の生物学的活性（特に除草性）化合物または活性剤（即ち、有効成分）との組合せは、雑草に対して相加的を超える（即ち相乗的）効果をもたらす、および / または、農作物または他の望ましい植物に対して拮抗作用（即ち、毒性緩和）をもたらすことが可能である。効果的な有害生物の防除を確保しつつ、環境中に放出される有効成分の量を低減させることが常に望ましい。より多くの量の有効成分を用

いて、過剰な農作物被害を伴うことなくより効果的な雑草防除をもたらす能力も同様に望ましい。雑草に対する除草用有効成分の相乗作用が農学的に十分なレベルの雑草防除をもたらす施用量で生じる場合、このような組合せは、農作物生産コストの削減および環境負荷の低減に有利となり得る。除草用有効成分の毒性緩和が農作物に生じる場合、このような組合せは、雑草との競合を低減させることによる農作物保護の強化に有利となり得る。

【0355】

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

【0356】

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

【0357】

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

【0358】

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

10

20

30

40

50

剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の成分とを含む組成物である。

【0359】

表A1には、本発明の混合物、組成物および方法の例示である、成分(a)と、成分(b)の特定の組合せが列挙されている。成分(a)欄中の化合物1が索引表Aにおいて特定されている。表A1の第2の欄には、特定の成分(b)化合物(例えば、第1行に「2,4-D」)が列挙されている。表A1の第3、第4および第5欄には、圃場で栽培されている農作物に対し、成分(b)に対して成分(a)化合物が典型的に施用される割合の重量比(即ち、(a):(b))の範囲が列挙されている。従って、例えば、表A1の第1行には、成分(a)(即ち、索引表Aの化合物1)と2,4-Dとの組合せは、典型的には、1:192と6:1の間の重量比で施用されることが具体的に開示されている。表A1の残りの行も、同様に解釈すべきである。10

【0360】

【表 3 7】

表 A1

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

【0361】

【表38】

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

10

20

30

40

【0362】

【表39】

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

【0363】

【表40】

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

【0364】

【表41】

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

【0365】

【表42】

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

【表43】

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

【0367】

表A2は、「成分(a)」欄見出しの下の項目が、以下に示すそれぞれの成分(a)欄の項目で置き換えられていることを除き、上記表A1と同様に構成されている。成分(a)欄の化合物2が、索引表Aにおいて特定されている。従って、例えば、表A2において、「成分(a)」欄見出しの下の項目は全て「化合物2」(即ち、索引表Aにおいて特定されている化合物2)を列挙し、表A2における欄見出しの下の第1行は、化合物2と2,4-Dとの混合物を具体的に開示している。表A3~A7も同様に構成されている。

【0368】

10

20

30

【表44】

表番号	成分(a)欄の項目	表番号	成分(a)欄の項目
A2	化合物 2	A38	化合物 38
A3	化合物 3	A39	化合物 39
A4	化合物 4	A40	化合物 40
A5	化合物 5	A41	化合物 41
A6	化合物 6	A31	化合物 42
A7	化合物 7	A43	化合物 43
A8	化合物 8	A44	化合物 44
A9	化合物 9	A45	化合物 45
A10	化合物 10	A46	化合物 46
A11	化合物 11	A47	化合物 47
A12	化合物 12	A48	化合物 48
A13	化合物 13	A49	化合物 49
A14	化合物 14	A50	化合物 50
A15	化合物 15	A51	化合物 51
A16	化合物 16	A52	化合物 52
A17	化合物 17	A53	化合物 53
A18	化合物 18	A54	化合物 54
A19	化合物 19	A55	化合物 55
A20	化合物 20	A56	化合物 56
A21	化合物 21	A57	化合物 57
A22	化合物 22	A58	化合物 58
A23	化合物 23	A59	化合物 59
A24	化合物 24	A60	化合物 60
A25	化合物 25	A61	化合物 61
A26	化合物 26	A62	化合物 62
A27	化合物 27	A63	化合物 63
A28	化合物 28	A64	化合物 64
A29	化合物 29	A65	化合物 65
A30	化合物 30	A66	化合物 66
A31	化合物 31	A67	化合物 67
A32	化合物 32	A68	化合物 68
A33	化合物 33	A69	化合物 69
A34	化合物 34	A70	化合物 70
A35	化合物 35	A71	化合物 71
A36	化合物 36	A72	化合物 72
A37	化合物 37		

【0369】

望ましくない植生のより良好な防除（例えば相乗作用、防除される雑草の範囲の拡大、または、農作物の安全性の強化などによる使用量の低減）のために、または、抵抗性雑草の発生を防止するために、本発明の化合物と、クロリムロン-エチル、ニコスルフロン、

メソトリオン、チフェンスルフロン - メチル、フルピルスルフロン - メチル、トリベヌロン、ピロキサスルホン、ピノキサデン、テンボトリオン、ピロキシスマム、メトラクロールおよびS - メトラクロールからなる群から選択される除草剤との混合物が好適である。

【0370】

以下の試験は、特定の雑草に対する本発明の化合物の防除効能を実証する。しかしながら、これらの化合物によって得られる雑草防除はこれらの種に限定されない。化合物の説明については索引表Aを参照されたい。以下の索引表において、以下の略語が使用されている：c - P r はシクロプロピルであり、「C m p d . N o .」は「化合物番号」を表し、「E x .」は「実施例」を表し、どの実施例においてその化合物が製造されているかを示す数字が続いている。別段の指示がない限り、以下の索引表において、X¹、X²、X³、X⁴、X⁵、X⁶、X⁷、X⁸、X⁹およびX¹⁰のそれぞれは、CHである。¹H

NMRスペクトルは、別段の指示がない限り、CDC₃溶液中のテトラメチルシランからの低磁場側のppmで報告されており；「s」は一重項を意味し、「d」は二重項を意味し、「dd」は二重項の二重項を意味し、「t」は三重項を意味し、「q」は四重項を意味し、「m」は多重項を意味し、「brs」は広幅一重項を意味する。質量スペクトルは、大気圧化学イオン化(AP+)を用いて観察される、H⁺(分子量1)の分子への付加によって形成される同位体存在度が最も高い親イオン(M+1)の分子量として、±0.5Daの推定精度で報告される。

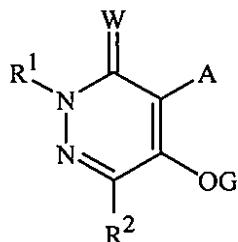
【0371】

【化44】

10

20

索引表A



1

30

【0372】

【表 4 5】

化合物				([°] C)または AP+		
番号	(R ¹)	R ²	W	G		
1	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、Sであり、X ⁶ は、Nである) A-4(Y ⁴ は、Sであり、X ¹ は、CCH ₃ で あり、X ⁷ は、Nであり、X ⁹ は、CCH ₃ である)	H	199-203
2	CH ₃	CH ₃	O	A-4(Y ⁴ は、Sであり、X ¹ は、CCH ₃ で あり、X ⁷ は、Nであり、X ⁹ は、CCH ₃ である)	C(O)OCH ₂ CH ₃	175-178
3	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、Sである) A-4(Y ⁴ は、Sであり、X ¹ は、CCH ₃ で あり、X ⁷ は、Nであり、X ⁹ は、CCH ₃ である)	H	257-259
4	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、Sである)	C(O)CH ₂ CH ₃	130-134
5	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、Sである) A-4(Y ⁴ は、Sであり、X ¹ は、CCH ₃ で あり、X ⁷ は、Nであり、X ⁹ は、CCH ₃ である)	C(O)OCH ₂ CH ₃	165-169
6	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ¹ は、CCH ₃ で あり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	C(O)-i-Pr	145-148
7	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ¹ は、CCH ₃ で あり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	H	244-247
8	CH ₃	CH ₃	O	A-3(X ² は、Nである) A-4(Y ⁴ は、Sであり、X ¹ は、CCH ₃ で あり、X ⁷ は、Nであり、X ⁹ は、CCH ₃ である)	C(O)CH ₃	310 (AP ⁺)
9	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ¹ は、CCH ₃ で あり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	C(O)-c-Pr	139-142
10	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ¹ は、CCH ₃ で あり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	H	194-199
11	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ¹ は、CCH ₃ で あり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	C(O)CH ₃	93-96
12(実施 例 1)	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ⁵ は、CCH ₃ で ある)	H	272-275
13(実施 例 2)	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ⁵ は、CCH ₃ で ある)	C(O)CH ₃	144-147

【0 3 7 3】

【表46】

化合物 番号	(R^1)	R^2	W	A	$(^{\circ}C)$ または (AP^+)	
					G	AP^+
14	CH ₃	CH ₃	O	A-4(Y^4 は、Sであり、 X^1 は、CCH ₃ であり、 X^7 は、Nである)	H	246-250
15	CH ₃	CH ₃	O	A-4(Y^4 は、Sであり、 X^1 は、CCH ₃ であり、 X^7 は、Nである)	C(O)O-i-Pr	93-97
16	CH ₃	CH ₃	O	A-3(X^2 は、Nであり、 X^3 は、COCH ₃ である)	H	298 (AP^+)
17	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y^2 は、Oであり、 X^1 は、CCH ₃ であり、 X^5 は、CCH ₃ である)	C(O)OCH ₃	131-134
18	CH ₃	CH ₃	O	A-4(Y^4 は、Sであり、 X^1 は、CCH ₂ CH ₃ であり、 X^7 は、Nである)	H	212-215
19	CH ₃	CH ₃	O	A-4(Y^4 は、Sであり、 X^1 は、CCH ₂ CH ₃ であり、 X^7 は、Nである)	C(O)OCH ₂ CH ₃	143-146
20	CH ₃	CH ₃	O	A-4(Y^4 は、Sであり、 X^1 は、CCH ₂ CH ₃ であり、 X^7 は、Nである)	C(O)O-i-Pr	158-161
21	CH ₃	CH ₃	O	A-4(Y^4 は、Sであり、 X^1 は、CCH ₂ CH ₃ であり、 X^7 は、Nである)	C(O)-c-Pr	138-141
22	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y^2 は、Oであり、 X^1 は、CCH ₃ であり、 X^5 は、CCH ₃ である)	C(O)CH ₂ CH ₃	117-121
23	CH ₃	CH ₃	O	A-4(Y^4 は、Sであり、 X^1 は、CCH ₃ であり、 X^7 は、Nである)	C(O)-c-Pr	106-110
24	CH ₃	CH ₃	O	A-4(Y^4 は、Sであり、 X^1 は、CCH ₃ であり、 X^7 は、Nである)	C(O)OCH ₂ CH ₃	
25	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y^1 は、Sであり、 X^5 は、Nであり、 X^6 は、CCH ₃ である)	H	115-118
26	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y^2 は、Oであり、 X^5 は、CCH ₃ である)	C(O)CH ₂ CH ₃	147-150
27	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y^1 は、Sであり、 X^5 は、CCH ₃ であり、 X^6 は、Nである)	H	219-222
28	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y^2 は、Oであり、 X^5 は、CCH ₃ である)	C(O)OCH ₃	
29(実施 例3)	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y^1 は、Sであり、 X^1 は、CCH ₃ である)	H	204-207
30	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y^1 は、Sであり、 X^1 は、CCH ₃ である)	C(O)OCH ₂ CH ₃	103-107
31	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y^1 は、Sであり、 X^1 は、CCH ₃ である)	C(O)CH ₂ CH ₃	122-125
32	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y^1 は、Sである)	H	267-272
33	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y^2 は、Oであり、 X^3 は、CFである)	C(O)CH ₃	*
34	CH ₃	H	O	A-3(X^8 は、Nである)	H	*
35	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y^2 は、Sであり、 X^3 は、CClである)	C(O)Ph	148-152

【表47】

番号	(R ¹)	R ²	W	A	℃)または	
					G	AP+
36	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Sであり、X ³ は、CClである)	C(O)CH ₂ CH ₃	128-132
37	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、Sであり、X ³ は、CClであり、X ⁵ は、CBrである)	H	240-244
38	CH ₃	Cl	O	A-1(Y ¹ は、NHであり、X ⁵ は、Nであり、X ⁶ は、Nである)	H	278
39	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ³ は、CClであり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	C(O)Ph	122-126
40	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ³ は、CClであり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	C(O)OCH ₃	155-159
41	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ³ は、CClであり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	C(O)CH ₂ CH ₃	361 *
42	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ³ は、CClであり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	C(O)CH ₃	133-137
43	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ³ は、CClであり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	H	302-306
44	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、Oであり、X ³ は、CClであり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	C(O)Ph	141-145
45	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、Oであり、X ³ は、CClであり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	H	249-253
46	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、Sであり、X ¹ は、CCH ₃ であり、X ⁵ は、CClである)	H	240-243
47	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ¹ は、CCF ₃ であり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	C(O)CH ₂ CH ₃	99-103
48	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ¹ は、CCF ₃ であり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	C(O)CH ₃	142-146
49	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ¹ は、CCF ₃ であり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	H	244-248
50	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Sであり、X ³ は、CClである)	C(O)OCH ₃	159-163
51	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Sであり、X ³ は、CClである)	C(O)CH ₃	165-169
52	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、Oであり、X ³ は、CClであり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	C(O)CH ₂ CH ₃	120-124
53	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、Oであり、X ³ は、CClであり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	C(O)OCH ₃	123-127
54	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、Oであり、X ³ は、CClであり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	C(O)CH ₃	163-167
55	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Sであり、X ³ は、CClである)	H	268-272
56	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ³ は、CClである)	H	*

【0375】

【表 4 8】

化合物					(°C)または AP+		
番号	(R ¹)	R ²	W	A	G		
57	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、Sであり、X ³ は、CClである)	C(O)Ph	166-170	
58	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、Sであり、X ³ は、CClである)	C(O)CH ₂ CH ₃	143-147	
59	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、Sであり、X ³ は、CClである)	C(O)OCH ₃	176-180	10
60	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、Sであり、X ³ は、CClである)	C(O)CH ₃	169-173	
61	CH ₃	Cl	O	A-1(Y ¹ は、NCH ₃ であり、X ⁵ は、Nであり、X ⁶ は、Nである)	H	290 (AP-)	
62	CH ₃	Cl	O	A-2(Y ² は、NCH ₃ であり、X ⁴ は、Nであり、X ⁵ は、Nである)	H	282	
63	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、Sであり、X ³ は、CClである)	H	268-272	
64	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、NCH ₃ であり、X ¹ は、CBrであり、X ⁵ は、Nである)	C(O)CH ₂ CH ₃	142-146	20
65	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、NCH ₃ であり、X ¹ は、CBrであり、X ⁵ は、Nである)	H	316-320	
66	CH ₃	Cl	O	A-3(X ¹ は、Nである)	C(O)CH ₃	330	
67(実施例 4)	CH ₃	Cl	O	A-3(X ¹ は、Nである)	H	288	
68(実施例 6)	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ³ は、CFである)	H	275	
69(実施例 5)	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ³ は、CFである)	CH ₃	289	30
70	CH ₃	Cl	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ³ は、CFである)	H	*	
71	CH ₃	Cl	O	A-3(X ¹⁰ は、Nである)	C(O)CH ₃	*	
72	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、Sであり、X ¹ は、CCH ₃ であり、X ⁵ は、CCH ₃ である)	H	227-230	

* ¹H NMR データについては、索引表 B を参照されたい。** ¹H NMR データについては、合成例を参照されたい。

【表49】

索引表B

化合物 番号	¹ H NMR データ(他様に示されない限り、CDCl ₃ 溶液) ^a
33	δ 7.60 (m, 1H), 7.27–7.31 (m, 1H), 6.99–7.02 (m, 1H), 6.90 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 1.94 (s, 3H).
34	δ (dmso-d ₆ , 500MHz) 11.17 (brs, 1H), 9.41 (brs, 1H), 8.50 (brs, 1H), 8.16 (d, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.43 (brs, 1H), 3.66 (s, 3H). 10
41	δ 7.23–7.21 (d, 1H, J = 8.4 Hz), 7.14–7.12 (d, 1H, J = 8.4 Hz), 6.49 (s, 1H), 3.82 (s, 1H), 2.43 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.23–2.18 (q, 2H), 0.94–0.91 (t, 3H).
56	δ 7.69 (m, 1H), 7.36–7.44 (m, 3H), 6.96 (m, 1H), 3.78 (s, 3H), 2.36 (s, 3H).
70	δ (DMSO-d ₆) 8.02 (m, 1H), 7.28–7.31 (m, 1H), 7.15–7.19 (m, 1H), 7.11–7.12 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.62 (s, 3H).
71	δ (500Hz) 8.88 (dd, 1H), 8.19 (dd, 1H), 7.92 (m, 1H), 7.59 (m, 2H), 7.43 (dd, 1H), 3.84 (s, 3H), 1.95 (s, 3H).

【0377】

20

本発明の生物学的実施例

試験 A

イヌビエ(エチノクロア・クルス - ガルリ(*Echinocloa crus-gallici*))、ホウキギ(コチア・スコパリア(*Kochia scoparia*))、ブタクサ(common ragweed、アンブロシア・エラチオル(*Ambrosia elatior*))、イタリアンライグラス(Italian ryegrass、口リウム・マルティフロルム(*Lolium multiflorum*))、アキノエノコログサ(giant foxtail、セタリア・ファベリイ(*Setaria faberii*))、およびアカザ(アマランサス・レトロフレックサス(*Amaranthus retroflexus*))から選択される植物種の種子をローム土壤と砂とのブレンドに蒔き、界面活性剤を含む非植物毒性溶媒混合物に配合した試験化学物質を用いて直接土壤噴霧で発生前処理した。 30

【0378】

同時に、これらの雑草種、ならびに、コムギ(トリチクム・アエスキブム(*Triticum aestivum*))、コーン(ゼア・マイズ(*Zea mays*))、プラックグラス(アロペクルス・ミオスロイデス(*Alopexurus myosuroides*))およびヤエムグラ(catchweed bedstraw、ガリウム・アパリネ(*Gallium aparine*))から選択される植物を同一のローム土壤と砂とのブレンドを含有するポットに植え、同様に配合した試験化学物質の発生後適用で処理した。発生後処理に関して、植物は、2~10cmの範囲の高さであり、1~2葉展開期のものであった。処理した植物および未処理の対照を温室中におよそ10日間維持し、その後、全ての処理した植物を未処理の対照と比較し、被害について視覚的に評価した。表Aにまとめられている植物の応答評価は0~100スケールに基づいており、ここで、0は効果無しであり、100は完全な防除である。ダッシュ記号(-)による応答は、試験結果が得られなかったことを意味する。 40

【0379】

【表 5 0】

表 A	化合物														表 A	化合物															
1000 g ai/ha	35														1000 g ai/ha	35															
発生後															発生後																
イヌビエ	20														エノコログサ	0															
ブラックグラス	30														ホウキギ	0															
コーン	0														アカザ	0															
ヤエムグラ	100														ブタクサ	0														10	
エノコログサ	0														イタリアンライグラス	70															
ホウキギ	0														コムギ	0															
表 A	化合物														表 A	化合物															
500 g ai/ha	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14																	
発生後																															
イヌビエ	0	20	30	20	20	10	80	20	20	90	60	30	50	0																	
ブラックグラス	10	40	40	30	60	20	90	0	20	90	90	80	80	0															20		
コーン	0	0	0	0	0	0	60	0	0	30	30	10	20	0																	
アキノエノコログサ	0	20	30	20	20	40	90	20	40	90	80	40	50	0																	
ヤエムグラ	30	80	80	90	80	70	100	80	60	100	90	90	90	40																	
ホウキギ	0	90	90	20	20	60	100	80	50	100	100	50	80	0																	
アカザ	10	90	90	30	20	80	90	80	80	100	100	50	70	0																	
ブタクサ	10	50	50	40	20	30	90	0	30	100	100	80	70	0																	
イタリアンライグラス	40	90	80	100	90	60	100	30	60	100	100	100	100	20																	
コムギ	0	20	20	0	20	0	70	0	0	60	40	20	20	0															30		
表 A	化合物														表 A	化合物															
500 g ai/ha	15	16	18	19	20	21	23	24	25	27	29	30	31	32																	
発生後																															
イヌビエ	0	10	0	0	0	0	0	0	40	20	70	80	60	50	10																
ブラックグラス	0	20	0	0	0	0	0	0	30	30	80	90	60	30	10																
コーン	0	0	0	0	0	0	20	10	20	0	50	40	40	0	0																
アキノエノコログサ	0	0	0	0	0	0	0	0	80	40	80	70	80	40	0																
ヤエムグラ	0	100	20	20	40	20	0	0	90	60	100	100	100	80	90														40		
ホウキギ	0	100	0	0	0	0	0	0	100	0	100	100	100	70	20																
アカザ	0	70	30	30	50	30	40	10	90	0	100	90	90	30	60																
ブタクサ	0	70	0	0	0	0	0	0	90	30	80	90	80	40	60																
イタリアンライグラス	0	100	0	0	0	0	10	20	70	40	90	100	100	90	60																
コムギ	0	0	0	0	0	0	0	0	30	0	30	30	30	20	0																

【0380】

【表 5 1】

		化合物													
125 g ai/ha		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
発生後															
イヌビエ		0	0	0	0	0	0	30	0	0	50	30	10	0	0
ブラックグラス		0	20	20	20	30	0	80	0	0	60	60	40	60	0
コーン		0	0	0	0	0	0	0	0	0	10	0	0	0	0
アキノエノコログサ		0	0	0	0	0	20	80	0	0	80	60	20	30	0
ヤエムグラ		0	40	30	70	30	50	100	10	50	100	90	80	80	0
ホウキギ		0	30	30	0	0	30	100	30	40	100	100	0	50	0
アカザ		0	70	80	20	0	20	90	70	50	90	90	30	60	0
ブタクサ		0	20	20	0	0	10	90	0	10	100	100	40	50	0
イタリアンライグラス		0	30	20	80	70	20	100	0	30	100	100	90	90	0
コムギ		0	0	0	0	0	0	20	0	0	20	0	0	0	0
表 A		化合物													20
125 g ai/ha		15	16	17	18	19	20	21	22	23	24	25	26	27	28
発生後															
イヌビエ		0	0	20	0	0	0	0	10	0	0	20	10	0	10
ブラックグラス		0	0	40	0	0	0	0	80	0	0	20	20	0	30
コーン		0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
アキノエノコログサ		0	0	50	0	0	0	0	70	0	0	30	30	20	20
ヤエムグラ		0	70	100	0	0	10	10	90	0	0	80	90	0	80
ホウキギ		0	70	90	0	0	0	0	90	0	0	100	20	0	40
アカザ		0	40	100	0	10	20	10	90	0	0	90	40	0	40
ブタクサ		0	30	80	0	0	0	0	90	0	0	70	30	0	60
イタリアンライグラス		0	90	100	0	0	0	0	80	0	0	20	80	20	60
コムギ		0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20	0	0	0
表 A		化合物													
125 g ai/ha		29	30	31	32	33	34	36	37	38	39	40	41	42	43
発生後															40
イヌビエ		20	10	10	0	30	0	10	0	0	10	20	50	40	10
ブラックグラス		70	40	50	0	20	0	0	0	0	20	20	50	50	50
コーン		20	20	20	0	20	0	0	0	0	0	10	20	10	0
アキノエノコログサ		20	10	10	0	30	-	0	0	0	10	20	60	30	0
エノコログサ		-	-	-	-	-	0	-	-	-	-	-	-	-	-
ヤエムグラ		90	90	90	40	90	0	100	40	0	90	100	100	90	80
ホウキギ		90	90	90	20	100	0	30	10	0	0	0	0	0	0

【0381】

【表 5 2】

アカザ	90	90	90	30	80	0	30	0	0	0	40	70	50	0
ブタクサ	80	60	70	0	60	0	0	0	0	10	40	80	10	20
イタリアンライグラス	100	100	100	70	100	0	80	0	0	30	70	100	90	80
コムギ	20	0	20	0	20	0	0	0	0	0	0	0	0	10

表 A 化合物

125 g ai/ha	44	45	46	47	48	49	50	51	52	53	54	55	56	57
発生後														10

イヌビエ	0	0	30	10	10	10	10	10	0	10	0	10	10	0
ブラックグラス	0	0	70	0	0	0	10	10	0	0	0	10	0	0
コーン	0	0	20	0	20	20	0	0	0	0	0	0	0	0
アキノエノコログサ	0	0	90	-	-	-	0	0	0	0	0	0	-	0
エノコログサ	-	-	-	10	10	30	-	-	-	-	-	-	10	-
ヤエムグラ	0	70	90	80	80	90	100	100	90	80	70	100	100	0
ホウキギ	0	0	90	70	70	80	90	90	0	0	10	100	0	0
アカザ	0	10	90	90	100	100	70	60	60	50	40	60	0	0
ブタクサ	0	0	100	80	90	90	70	50	20	30	0	30	0	0
イタリアンライグラス	0	60	100	30	30	40	90	100	40	30	60	70	50	0
コムギ	0	0	20	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0

表 A 化合物

125 g ai/ha	58	59	60	61	62	63	64	65	66	67	68	69	70	71	72
発生後															

イヌビエ	0	0	0	0	0	0	0	0	10	0	10	0	90	40	40
ブラックグラス	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	60	0	30	70	80
コーン	0	20	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
アキノエノコログサ	0	0	0	-	-	0	-	-	10	0	20	0	40	30	60
エノコログサ	-	-	-	0	0	-	0	0	-	-	-	-	-	-	-
ヤエムグラ	90	80	100	0	70	90	50	0	50	40	90	0	90	80	100
ホウキギ	60	60	70	0	0	60	0	0	40	40	90	0	90	-	90
アカザ	20	30	30	0	0	50	0	0	50	50	20	0	70	50	90
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	30	10	10	0	90	70	90
イタリアンライグラス	10	10	10	0	0	10	0	0	40	60	90	0	100	90	100
コムギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	30	0

表 A 化合物

31 g ai/ha	17	22	26	28	33	34	36	37	38	39	40	41	42	43
発生後														

イヌビエ	10	10	0	0	0	0	0	0	0	0	10	20	10	0
------	----	----	---	---	---	---	---	---	---	---	----	----	----	---

【0382】

【表 5 3】

ブラックグラス	10	30	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20	20	0
コーン	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
アキノエノコログサ	20	30	0	0	0	-	0	0	0	0	10	20	10	0
エノコログサ	-	-	-	-	-	0	-	-	-	-	-	-	-	-
ヤエムグラ	80	70	70	40	60	0	90	20	0	30	90	90	90	70
ホウキギ	70	70	20	0	60	0	20	0	0	0	0	0	0	0
アカザ	60	60	30	10	40	0	0	0	0	0	20	40	30	0
ブタクサ	70	70	0	20	0	0	0	0	0	0	20	80	20	0
イタリアンライグラス	50	70	50	30	40	0	30	0	0	20	40	90	70	50
コムギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0

表 A 化合物

31 g ai/ha	44	45	46	47	48	49	50	51	53	54	55	56	57	58
発生後														
イヌビエ	0	0	10	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ブラックグラス	0	0	40	-	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
コーン	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
アキノエノコログサ	0	0	50	-	-	-	0	0	0	0	0	-	0	0
エノコログサ	-	-	-	0	0	20	-	-	-	-	-	0	-	-
ヤエムグラ	0	20	90	70	80	80	100	100	60	50	80	60	0	20
ホウキギ	0	0	60	40	50	60	40	70	0	0	40	0	0	0
アカザ	0	0	90	90	70	90	60	50	30	30	30	0	0	0
ブタクサ	0	0	90	40	70	80	10	0	0	0	0	0	0	0
イタリアンライグラス	0	20	90	0	0	10	60	70	10	20	40	50	0	0
コムギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0

表 A 化合物

31 g ai/ha	59	60	61	62	63	64	65	66	67	68	69	70	71	72
発生後														
イヌビエ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	10	10	30
ブラックグラス	0	0	0	0	0	60	0	0	0	0	0	0	10	40
コーン	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
アキノエノコログサ	0	0	-	-	0	-	-	0	0	0	0	10	10	30
エノコログサ	-	-	0	0	-	0	0	-	-	-	-	-	-	-
ヤエムグラ	20	20	0	100	30	30	0	0	20	60	0	50	60	90
ホウキギ	0	20	0	0	0	0	0	0	0	20	0	40	-	70
アカザ	0	0	0	0	0	0	0	40	40	0	0	10	20	90
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	10	0	0	0	10	30	70

【0383】

【表 5 4】

イタリアンライグラス	0	0	0	0	0	0	0	20	20	80	0	70	50	90
コムギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0

【0 3 8 4】

【表 5 5】

表 A		化合物															
1000 g ai/ha	35	表 A		化合物													
発生前		500 g ai/ha	52	発生前													
イヌビエ	20	イヌビエ	0														
エノコログサ	0	アキノエノコログサ	0														
ホウキギ	0	ホウキギ	0														
アカザ	0	アカザ	100													10	
ブタクサ	10	ブタクサ	0														
イタリアンライグラス	80	イタリアンライグラス	70														
表 A		化合物															
500 g ai/ha		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14		
発生前																	
イヌビエ	20	20	10	20	40	0	90	0	0	90	100	50	60	0			
アキノエノコログサ	20	20	10	20	40	0	90	20	40	100	100	60	60	0			
ホウキギ	0	60	20	60	30	50	90	0	30	100	100	100	100	0		20	
アカザ	0	80	80	70	100	70	100	70	30	100	100	100	100	0			
ブタクサ	20	20	40	20	20	-	90	0	30	90	100	80	80	0			
イタリアンライグラス	70	100	70	100	100	50	100	30	70	100	100	100	100	20			
表 A		化合物															
500 g ai/ha		15	16	18	19	20	21	23	24	25	27	29	30	31	32		
発生前																	
イヌビエ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	40	0	90	90	90	40		
アキノエノコログサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	80	50	90	80	90	50		30
ホウキギ	0	100	0	0	0	0	0	0	0	100	0	90	80	90	40		
アカザ	0	100	10	20	40	0	0	0	100	0	100	100	100	100	100		
ブタクサ	0	70	0	0	0	0	0	0	0	70	20	90	90	90	80		
イタリアンライグラス	0	90	0	0	0	0	0	0	20	30	40	100	100	100	100		
表 A		化合物															
125 g ai/ha		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14		
発生前																	
イヌビエ	0	0	0	0	0	0	10	0	0	80	50	0	20	0		40	
アキノエノコログサ	0	0	0	0	0	20	20	0	0	80	50	10	10	0			
ホウキギ	0	0	0	0	10	0	30	0	0	100	90	60	0	0			
アカザ	0	0	40	40	20	0	100	20	0	100	100	60	40	0			
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	40	0	-	90	90	60	40	0			

【0385】

【表 5 6】

イタリアンライグラス	0	30	30	40	80	0	100	0	30	100	100	100	100	10
------------	---	----	----	----	----	---	-----	---	----	-----	-----	-----	-----	----

表 A

化合物

125 g ai/ha	15	16	17	18	19	20	21	22	23	24	25	26	27	28
-------------	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----

発生前

イヌビエ	0	0	0	0	0	0	0	10	0	0	0	0	0	0
アキノエノコログサ	0	0	10	0	0	0	0	50	0	0	30	0	0	0
ホウキギ	0	40	100	0	0	0	0	90	0	0	100	30	0	20
アカザ	0	30	100	0	0	0	0	100	0	0	80	10	0	0
ブタクサ	0	30	90	0	0	0	0	80	0	0	40	10	20	30
イタリアンライグラス	0	80	90	0	0	0	0	80	0	10	0	80	30	70

表 A

化合物

125 g ai/ha	29	30	31	32	33	34	36	37	38	39	40	41	42	43
-------------	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----

発生前

イヌビエ	10	0	10	20	30	0	0	0	0	0	20	70	60	30
アキノエノコログサ	10	0	10	10	30	-	0	0	0	0	20	80	50	40
エノコログサ	-	-	-	-	-	0	-	-	-	-	-	-	-	-
ホウキギ	20	10	20	30	40	0	0	0	0	0	0	0	0	0
アカザ	40	90	90	40	70	0	90	0	0	0	60	90	40	0
ブタクサ	30	20	20	0	30	0	0	50	0	0	50	70	40	30
イタリアンライグラス	90	90	90	70	100	0	90	0	0	50	90	100	90	80

表 A

化合物

125 g ai/ha	44	45	46	47	48	49	50	51	52	53	54	55	56	57
-------------	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----

発生前

イヌビエ	0	0	50	30	20	0	10	20	0	30	0	0	0	0
アキノエノコログサ	0	0	80	-	-	-	10	0	0	0	0	0	-	0
エノコログサ	-	-	-	0	20	0	-	-	-	-	-	-	0	-
ホウキギ	0	0	80	50	20	40	20	20	0	0	0	20	0	0
アカザ	0	50	100	100	100	100	100	60	70	40	20	60	40	0
ブタクサ	0	10	80	80	90	90	20	0	0	0	10	0	0	0
イタリアンライグラス	20	30	100	80	20	50	80	100	50	60	50	100	70	10

表 A

化合物

125 g ai/ha	58	59	60	61	62	63	64	65	66	67	68	69	70	71	72
-------------	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----	----

発生前

イヌビエ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20	0	90	20	30	
アキノエノコログサ	0	0	0	-	-	0	-	-	0	0	20	0	50	10	40
エノコログサ	-	-	-	0	0	-	0	0	-	-	-	-	-	-	-

【表 5 7】

ホウキギ	70	20	0	0	0	20	0	0	0	0	60	0	40	30	40
アカザ	0	0	100	0	0	0	0	0	20	20	80	0	30	60	70
ブタクサ	80	30	0	0	0	0	0	0	0	0	50	0	0	10	90
イタリアンライグラス	50	10	10	0	0	20	0	0	50	50	80	0	100	80	100

表 A 化合物

31 g ai/ha 17 22 26 28 33 34 36 37 38 39 40 41 42 43

発生前

イヌビエ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 10 10

10

アキノエノコログサ 0 0 0 0 0 - 0 0 0 0 0 0 20 10 10

エノコログサ - - - - - 0 - - - - - - - -

ホウキギ 40 30 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

アカザ 30 100 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

ブタクサ 30 20 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 30 30

イタリアンライグラス 40 30 10 20 50 0 20 0 0 10 80 90 60 60

20

表 A 化合物

31 g ai/ha 44 45 46 47 48 49 50 51 53 54 55 56 57 58

発生前

イヌビエ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0

アキノエノコログサ 0 0 30 - - - 0 0 0 0 0 0 - 0 20

エノコログサ - - - 0 0 0 - - - - - 0 - - -

ホウキギ 0 0 50 40 10 0 0 0 0 0 0 0 0 50 0

アカザ 0 0 100 60 20 30 0 0 0 0 0 0 0 0 20

30

ブタクサ 0 0 80 20 0 0 0 0 20 0 0 0 0 0 0 0

イタリアンライグラス 0 0 90 0 10 20 60 60 0 30 80 10 0 0 0

表 A 化合物

31 g ai/ha 59 60 61 62 63 64 65 66 67 68 69 70 71 72

発生前

イヌビエ 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 40 0 0

アキノエノコログサ 0 0 - - 0 - - 0 0 0 0 10 0 0 0

エノコログサ - - 0 0 - 0 0 - - - - - - - -

40

ホウキギ 10 0 0 0 10 0 0 0 0 30 0 0 0 0 0

アカザ 0 0 0 0 0 0 0 10 10 0 0 10 0 0 70

ブタクサ 50 0 0 0 0 0 0 0 0 30 0 0 0 0 70

イタリアンライグラス 10 0 0 0 0 0 0 0 10 20 0 70 20 90

【0387】

試験 B

イネ(オリザ・サティバ(*Oryza sativa*))、タマガヤツリ(small flower umbrella sedge)、シペラス・ディフォルミス(Cype

50

r us diff or m i s)) 、アメリカコナギ(ヘテランテラ・リモサ(*H e t e r a n t h e r a l i m o s a*)) 、およびイヌビエ(エチノクロア・クルス - ガルリ(*E c h i n o c h l o a c r u s - g a l l i*)) から選択される、冠水させた水田試験における植物種を試験のために2葉展開期まで成長させた。処理時に、試験ポットを土壤表面より3cm上まで冠水させ、試験化合物を田面水に直接施用することにより処理し、次いで、この水深を試験期間中維持した。処理した植物および対照を温室中に13~15日間維持し、その後、全ての種を対照と比較し、視覚的に評価した。表Bにまとめられている植物の応答評価は0~100のスケールに基づいており、ここで、0は効果無しであり、100は完全な防除である。ダッシュ記号(-)による応答は、試験結果が得られなかったことを意味する。

【0388】

【表 5 8】

化合物														
250 g ai/ha	1	7	8	10	11	12	15	16	17	18	19	20	21	22
冠水														
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	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	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	10
化合物														
250 g ai/ha	23	24	25	26	27	28	29	30	31	32	33	34	36	37
冠水														
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	40	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	0	0	0	0	0	0	50	30	0	80	0
化合物														
250 g ai/ha	38	39	40	41	42	43	44	45	46	47	48	49	50	51
冠水														
イヌビエ	0	0	0	20	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
アメリカコナギ	0	50	0	20	80	40	0	30	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	75	60	35	0	50	70	0	0	0	0	0
化合物														
250 g ai/ha	52	53	54	55	56	57	58	59	60	61	62	63	64	65
冠水														
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	0
イネ	0	0	0	0	0	0	0	20	0	0	0	0	0	0
タマガヤツリ	0	0	70	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0
化合物														
250 g ai/ha	66	67	68	69	70	71	72							
冠水														
イヌビエ	0	0	0	0	0	0	0							
アメリカコナギ	0	0	0	0	0	0	0							
イネ	0	0	0	0	0	0	0							
タマガヤツリ	0	75	0	0	0	0	0							

フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I
C 0 7 D 403/04 (2006.01)	C 0 7 D 403/04
A 0 1 P 13/00 (2006.01)	A 0 1 P 13/00
A 0 1 N 43/90 (2006.01)	A 0 1 N 43/90 1 0 2
A 0 1 N 43/58 (2006.01)	A 0 1 N 43/58 B
A 0 1 N 43/80 (2006.01)	A 0 1 N 43/80 1 0 2
A 0 1 N 43/78 (2006.01)	A 0 1 N 43/78 1 0 1
A 0 1 N 47/06 (2006.01)	A 0 1 N 47/06 D
A 0 1 N 43/647 (2006.01)	A 0 1 N 43/647

(72)発明者 トーマス・ポール・セルピー

アメリカ合衆国デラウェア州19707.ホッケシン.ベンジ・ロード820

(72)発明者 キンバリー・キャサリン・マーカス

アメリカ合衆国ペンシルベニア州19063.メディア.ローカストレーン122

審査官 早乙女 智美

(56)参考文献 特開2013-028582(JP, A)

国際公開第2014/031971(WO, A1)

特表2015-517997(JP, A)

国際公開第2011/045271(WO, A1)

特表2011-507893(JP, A)

BABICHEV, F. S. et al., 6-Amino-1-aryl-4-pyridazinones and their derivatives, Ukrainskii Khimicheskii Zhurnal (Russian Edition), 1983年, 49(11), pp. 1197-1202

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C 0 7 D

A 0 1 N

A 0 1 P 1 3 / 0 0 - 1 3 / 0 2

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