

(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 I

C O 7 D 401/04 (2006.01)

C O 7 D 401/04

C O 7 D 405/04 (2006.01)

C O 7 D 405/04

C S P

C O 7 D 409/04 (2006.01)

C O 7 D 409/04

C O 7 D 417/04 (2006.01)

C O 7 D 417/04

C O 7 D 495/04 (2006.01)

C O 7 D 495/04

I O 5 A

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)
 (86) (22) 出願日 平成28年10月26日 (2016.10.26)
 (65) 公表番号 特表2018-533577 (P2018-533577A)
 (43) 公表日 平成30年11月15日 (2018.11.15)
 (86) 国際出願番号 PCT/US2016/058762
 (87) 国際公開番号 W02017/074992
 (87) 国際公開日 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)

(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
 (74) 代理人 100127926
 弁理士 結田 純次
 (74) 代理人 100140132
 弁理士 竹林 則幸
 (72) 発明者 トーマス・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

最終頁に続く

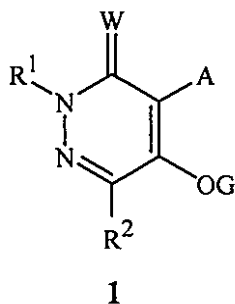
(54) 【発明の名称】 新規なピリダジノン除草剤

(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】



(式中、

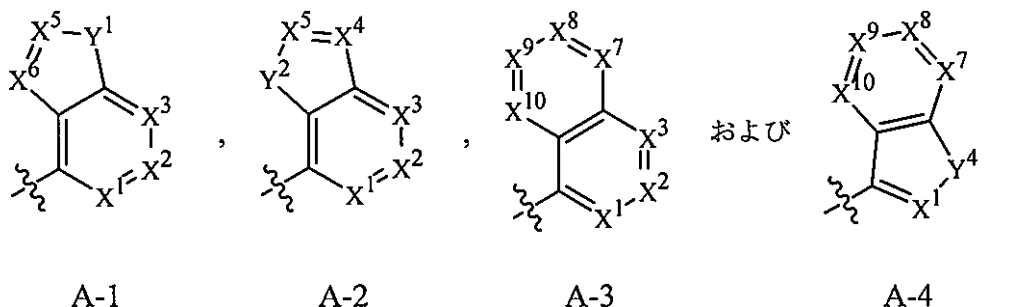
R¹ は、H、C₁ ~ C₇ アルキル、C₃ ~ C₈ アルキルカルボニルアルキル、C₃ ~ C₈ アルコキシカルボニルアルキル、C₄ ~ C₇ アルキルシクロアルキル、C₃ ~ C₇ アルケニル、C₃ ~ C₇ アルキニル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₄ ~ C₇ シクロアルキルアルキル、C₂ ~ C₃ シアノアルキル、C₁ ~ C₄ ニトロアルキル、C₂ ~ C₇ ハロアルコキシアルキル、C₁ ~ C₇ ハロアルキル、C₃ ~ C₇ ハロアルケニル、C₂ ~ C₇ アル

コキシアルキル、 $C_3 \sim C_7$ 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；

Aは、

【化2】



10

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、 $-C(=O)R^7$ 、 $-C(=S)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ 、 $-C(=O)SR^8$ 、 $-S(O)_2R^7$ 、 $-CONR^9R^{10}$ 、 $-S(O)_2NR^9R^{10}$ もしくは $P(=O)R^{11}$ ；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；

20

R^2 は、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、シクロプロピル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、メトキシまたはエトキシであり；

各 X^1 は、独立してNまたは CR^3 であり；

各 X^2 は、独立してNまたは CR^3 であり；

各 X^3 は、独立してNまたは CR^3 であり；

30

各 X^4 、 X^5 および X^6 は、独立してNまたは CR^4 であり；

各 X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} は、独立してNまたは CR^5 であり；

Y^1 は、OまたはSであり；

Y^2 は、OまたはSであり；

Y^4 は、OまたはSであり；

各 R^3 は、独立してH、ハロゲン、ニトロ、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルケニル、 $C_2 \sim C_5$ アルキニル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキルチオまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニルであり；

40

各 R^4 は、独立してH、ハロゲン、ニトロ、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルケニル、 $C_2 \sim C_5$ アルキニル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキルチオまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニルであり；

各 R^5 は、独立してH、ハロゲン、 $-CN$ 、ニトロ、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_2 \sim C_5$

50

アルケニル、 $C_2 \sim C_5$ アルキニル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキルチオまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニルであり；

R^7 は、 $C_1 \sim C_7$ 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、 $C_1 \sim C_7$ 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もしくは $C_4 \sim C_7$ 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、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルによって場合により置換されており；

10

R^8 は、 $C_1 \sim C_7$ 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、 $C_1 \sim C_7$ 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もしくは $C_4 \sim C_7$ 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、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルによって場合により置換されており；

R^9 は、 $C_1 \sim C_7$ 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、 $C_2 \sim C_7$ 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もしくは $C_4 \sim C_7$ 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、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルによって場合により置換されており；

20

R^{10} は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_2 \sim C_7$ アルケニル、 $C_2 \sim C_7$ 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、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^{11} は、 $C_1 \sim C_7$ アルキルまたは $C_1 \sim C_7$ アルコキシであり；

ただし、

i) AがA-3であり、 X^2 が CR^3 である場合、 X^3 は CR^3 以外であり；

ii) AがA-3であり、 X^3 が CR^3 である場合、 X^2 は CR^3 以外であり；

30

iii) AがA-4である場合、 X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} のうちの少なくとも1つは CR^5 以外であり；

iv) R^1 が CH_3 であり；GがHまたは $C(=O)CH_3$ であり； R^2 がClまたはBrである場合；A-3は4-キノリニル(5-Cl)、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】

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；

G^1 は、H、 $-C(=O)R^7$ 、 $-C(=S)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ 、 $-C(=O)SR^8$ 、 $-CONR^9R^{10}$ もしくは $P(=O)R^{11}$ ；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

50

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り；

W^1 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り；

R^2 は、 H 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、メチルまたはメトキシであり；

各 X^1 は、独立して CR^3 であり；

各 R^3 は、独立して H 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ アルコキシであり；

各 R^4 は、独立して H 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ アルコキシであり；

各 R^5 は、独立して H 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ アルコキシであり；

R^7 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^8 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^9 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^{10} は、 H 、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^{11} は、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_1 \sim C_3$ アルコキシである、
請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^1 は、 H 、 $C_1 \sim C_7$ 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、 $C_3 \sim C_7$ 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、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルキルチオアルキル、 $C_1 \sim C_7$ アルコキシまたはベンジルであり；

A は、 $A-1$ または $A-2$ であり；

G^1 は、 H 、 $-C(=O)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ 、 $-CONR^9R^{10}$ もしくは $P(=O)R^{11}$ ；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り；

W^1 は、 $-CH_2-$ または $-CH=CH-$ であり；

R^2 は、 H 、 Cl 、メチルまたはメトキシであり；

各 X^2 は、独立して CR^3 であり；

各 X^5 は、独立して CR^4 であり；

Y^1 は、O であり；

Y^2 は、O であり；

各 R^3 は、独立して H 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、シクロプロピルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルであり；

各 R^4 は、独立して H 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、シクロプロピルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルであり；

R^7 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^8 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^9 は、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^{10} は、 H 、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^{11} は、 CH_3 または OCH_3 である、

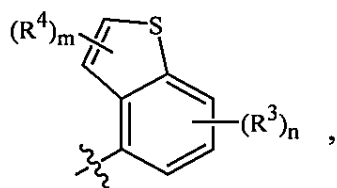
請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

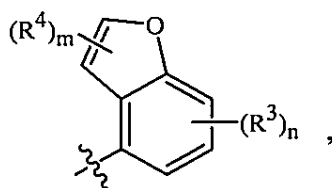
R^1 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_4$ アルコキシアルキルであり；

A は、

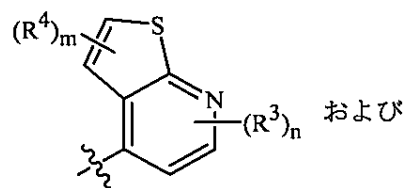
【化 3】



A-1-A

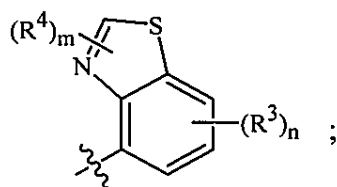


A-1-B



A-1-C

10



A-1-D

20

から選択され；

G^1 は、 H 、 $-C(=O)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ もしくは $P(=O)R^{11}$ ；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、 $-CH_2-$ であり；

R^2 は、 Cl または Me 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 CF_3 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 CF_3 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、 OCH_3 である、

請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

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-1-A および A-1-B から選択され；

G は、 G^1 であり；

G^1 は、 H 、 $-C(=O)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ ；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；

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、

請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

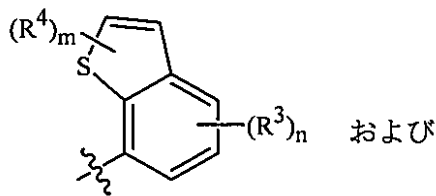
R^1 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_4$ アルコキシアルキルであり；

A は、

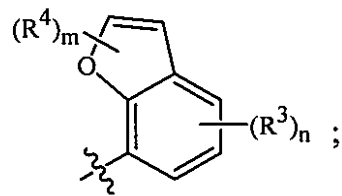
30

40

【化 4】



A-2-A



A-2-B

10

から選択され；

G^1 は、 H 、 $-C(=O)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ もしくは $P(=O)R^{11}$ ；または $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシアリルもしくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；

W^1 は、 $-CH_2-$ であり；

R^2 は、 Cl 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 CF_3 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 CF_3 であり；

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

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

R^{11} は、 OCH_3 である、

20

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、 G^1 であり；

G^1 は、 H 、 $-C(=O)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ ；または $C_1 \sim C_4$ アルコキシアリルもしくは $C_3 \sim C_6$ 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；

30

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

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

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；

40

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が

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(EPPS)シンターゼ阻害剤、(b6)光化学系II電子ダイパータ、(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)フィトエニ
10 デサチュラーゼ(PDS)阻害剤、(b12)4-ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)阻害剤、(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、プロモブチド、シンメシリン、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(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。

【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。

【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。

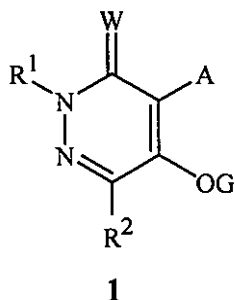
【発明の概要】

【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

【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；

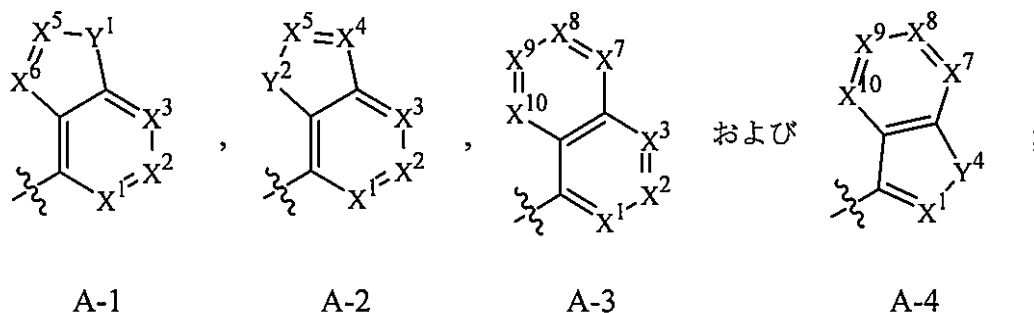
W は、O または S であり；

20

【0004】

A は、

【化 2】



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、 $-C(=O)R^7$ 、 $-C(=S)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ 、 $-C(=O)SR^8$ 、 $-S(O)_2R^7$ 、 $-CONR^9R^{10}$ 、 $-S(O)_2NR^9R^{10}$ もしくは $P(=O)R^{11}$ ；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；

40

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

50

コキシ、 $C_1 \sim C_5$ アルキルチオもしくは $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニル；またはハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルもしくは $C_1 \sim C_4$ 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 X^1 は、独立してNまたは CR^3 であり；

各 X^2 は、独立してNまたは CR^3 であり；

各 X^3 は、独立してNまたは CR^3 であり；

各 X^4 、 X^5 および X^6 は、独立してNまたは CR^4 であり；

各 X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} は、独立してNまたは CR^5 であり；

Y^1 は、O、Sまたは NR^6 であり；

Y^2 は、O、Sまたは NR^6 であり；

Y^4 は、O、Sまたは NR^6 であり；

各 R^3 は、独立してH、ハロゲン、ニトロ、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルケニル、 $C_2 \sim C_5$ アルキニル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキルチオまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニルであり；

各 R^4 は、独立してH、ハロゲン、ニトロ、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルケニル、 $C_2 \sim C_5$ アルキニル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキルチオまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニルであり；

各 R^5 は、独立してH、ハロゲン、 $-CN$ 、ニトロ、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルケニル、 $C_2 \sim C_5$ アルキニル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキルチオまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシカルボニルであり；

R^6 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_2 \sim C_7$ アルケニル、 $C_2 \sim C_7$ 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、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^7 は、 $C_1 \sim C_7$ 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、 $C_1 \sim C_7$ 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、 $C_4 \sim C_7$ 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、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルによって場合により置換されており；

R^8 は、 $C_1 \sim C_7$ 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、 $C_1 \sim C_7$ 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、 $C_4 \sim C_7$ 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、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルによって場合により置換されており；

R^9 は、 $C_1 \sim C_7$ 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、 $C_2 \sim C_7$ 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、 $C_4 \sim C_7$ 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

10

20

30

40

50

ン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルによって場合により置換されており；

R^{10} は、 H 、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_2 \sim C_7$ アルケニル、 $C_2 \sim C_7$ 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、 $C_1 \sim C_7$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^{11} は、 $C_1 \sim C_7$ アルキルまたは $C_1 \sim C_7$ アルコキシであり；

ただし、

i) A が $A-3$ であり、 X^2 が CR^3 である場合、 X^3 は CR^3 以外であり；

ii) A が $A-3$ であり、 X^3 が CR^3 である場合、 X^2 は CR^3 以外であり；

iii) A が $A-4$ であり、 Y^4 が O 、 S または NR^6 である場合、 X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} のうちの少なくとも1つは CR^5 以外であり；

iv) R^1 が CH_3 であり； G が H または $C(=O)CH_3$ であり； R^2 が Cl または Br である場合； $A-3$ は 4-キノリニル(5- Cl)、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。

【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って非排他的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。

【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、そうした移行句は、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。

【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

ising)」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って満たされる：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。従って、「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-プ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、アルキル上でのアルコキシ置換を表す。「アルコキシアルキル」の例としては、 CH_3OCH_2 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ が挙げられる。「アルコキシアルコキシ」は、アルコキシ上でのアルコキシ置換を表す。「アルキルチオ」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

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、 NCCCH_2 および $\text{NCCCH}_2\text{CH}_2$ (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_3CCl_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。「ハロアルコキシ」の例としては、 $\text{CF}_3\text{O}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 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、 $\text{HC}(\text{Cl})\text{CH}_2-$ 、 $\text{CF}_3\text{C}(\text{Cl})\text{CH}_2-$ および $\text{FCH}_2\text{C}(\text{Cl})\text{CH}_2-$ が挙げられる。

20

【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

50

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、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す、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、植物または土壌中で加水分解、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り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。

【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熔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。多形体に係る包括的な考察については、R. Hilfiker, Ed., polymorphism in the Pharmaceutical Industry, Wiley-VCH, Weinheim, 2006 を参照されたい。

【0026】

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。

【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。

【0028】

R^7 、 R^8 または R^9 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てもよい。上記のように、 R^7 、 R^8 または R^9 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る。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 R^7 、 R^8 または R^9 上の置換基として定義したものであり、 r は整数である。

【0029】

上記のように、 R^7 、 R^8 または R^9 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員不飽和芳香族複素環式環の例と

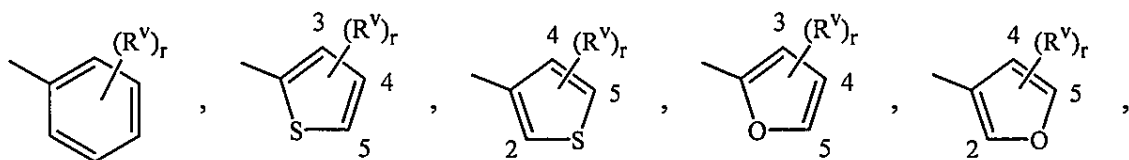
しては、提示 1 に図示する環 U - 2 ~ U - 6 1 が挙げられ、ここで、 R^v は、発明の概要において R^7 、 R^8 または R^9 について定義した任意の置換基（即ち、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル）であり、 r は 0 ~ 4 の整数であって、各 U 基上の利用可能な位置の数によって限定される。U - 29、U - 30、U - 36、U - 37、U - 38、U - 39、U - 40、U - 41、U - 42 および U - 43 は利用可能な位置が 1 つしかないため、これらの U 基については 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。

【 0 0 3 0 】

【 化 3 】

10

提示 1



U-1

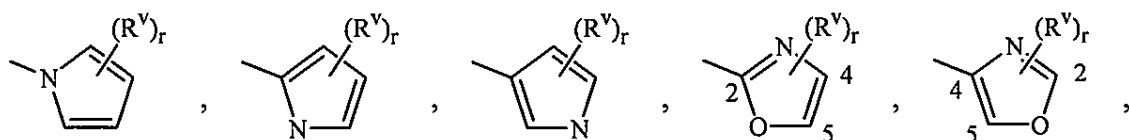
U-2

U-3

U-4

U-5

20



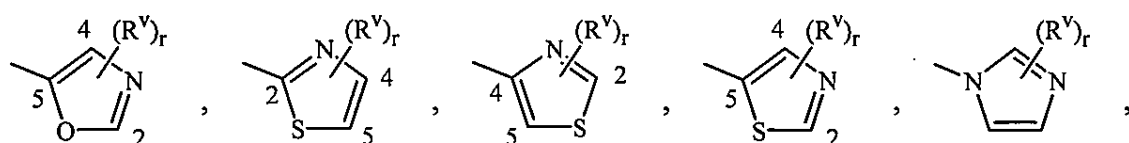
U-6

U-7

U-8

U-9

U-10



U-11

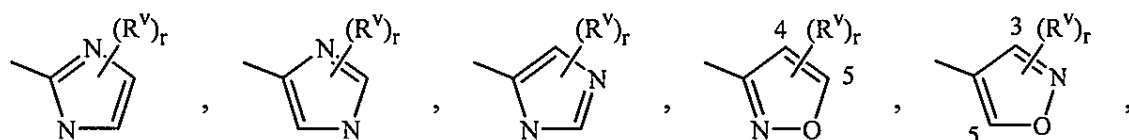
U-12

U-13

U-14

U-15

30



U-16

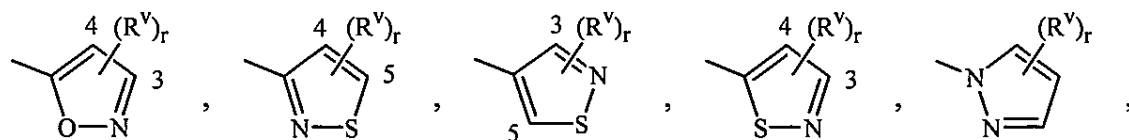
U-17

U-18

U-19

U-20

40



U-21

U-22

U-23

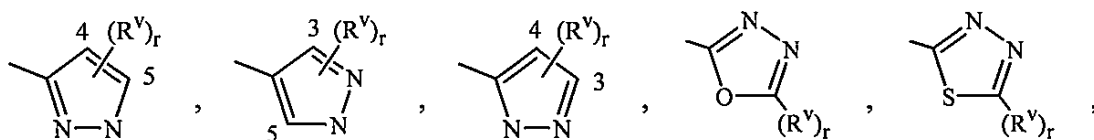
U-24

U-25

50

【 0 0 3 1 】

【 化 4 】



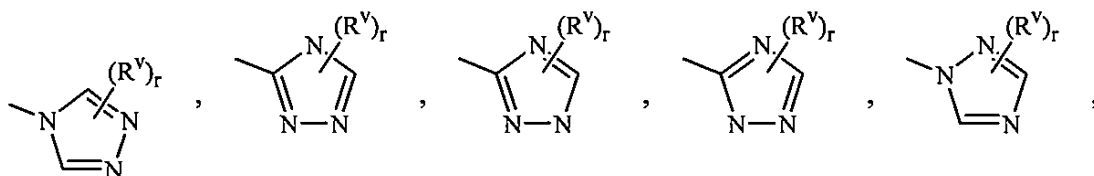
U-26

U-27

U-28

U-29

U-30



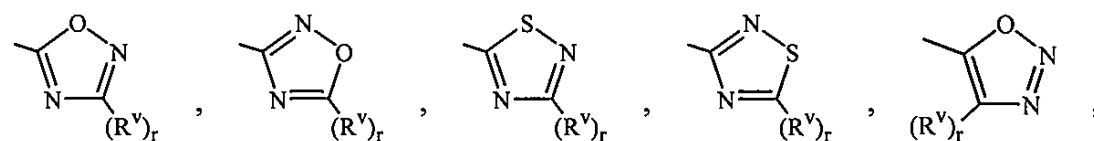
U-31

U-32

U-33

U-34

U-35



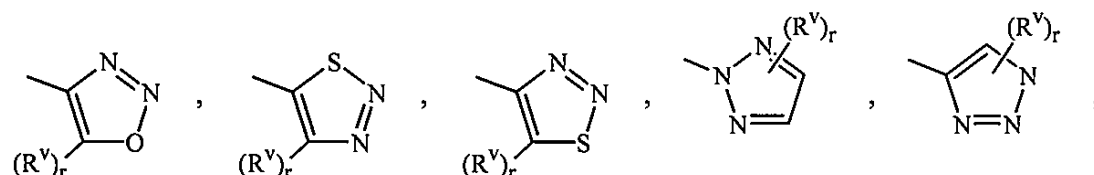
U-36

U-37

U-38

U-39

U-40



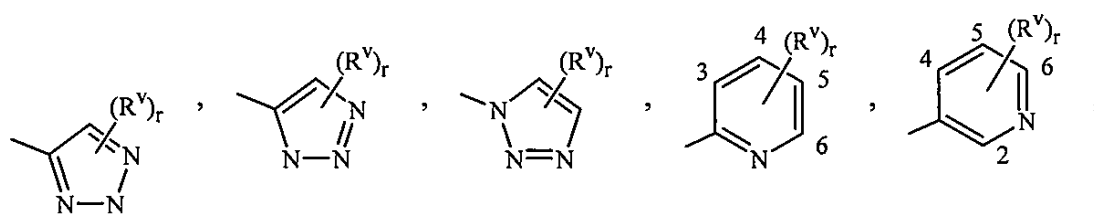
U-41

U-42

U-43

U-44

U-45



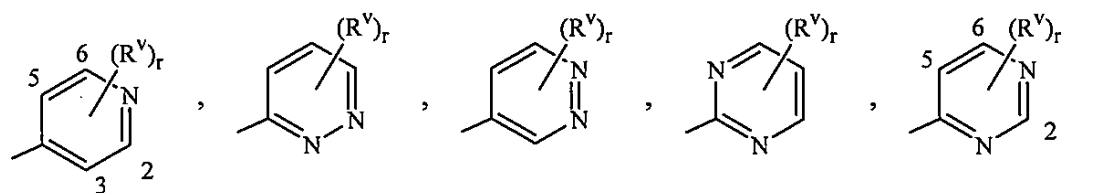
U-46

U-47

U-48

U-49

U-50



U-51

U-52

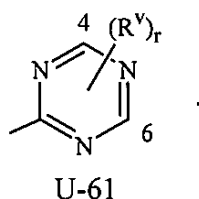
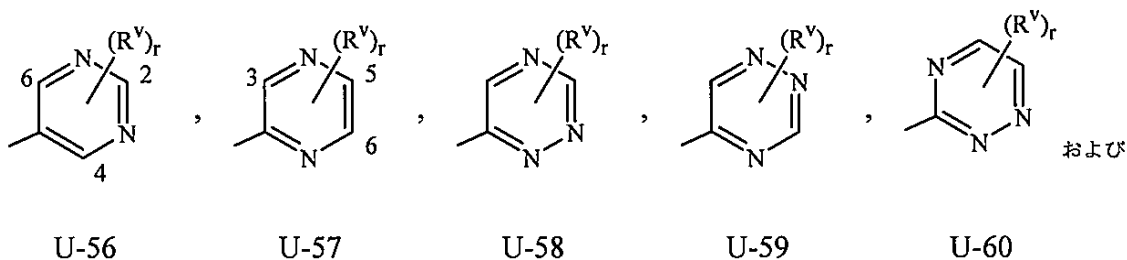
U-53

U-54

U-55

【 0 0 3 2 】

【化 5】



10

【 0 0 3 3 】

R^7 、 R^8 または R^9 が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

【 0 0 3 4 】

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

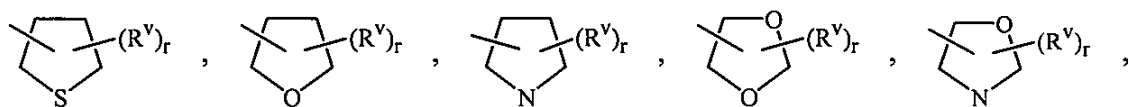
【 0 0 3 5 】

R^7 、 R^8 または R^9 が、T - 28 ~ T - 35 から選択される環を含む場合、 G^2 は O、S または N から選択されることに留意されたい。 T^2 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 R^7 、 R^8 または R^9 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。 R^1 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。

【 0 0 3 6 】

【化 6】

提示 2



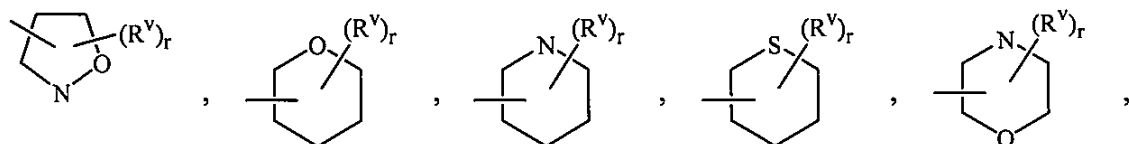
T-1

T-2

T-3

T-4

T-5



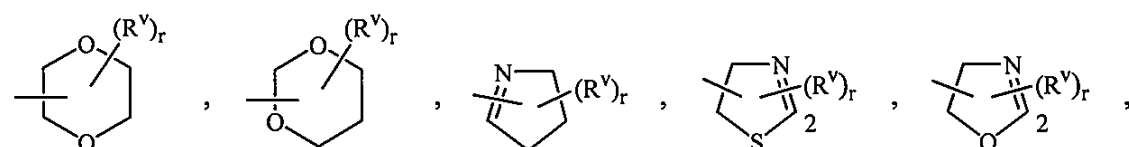
T-6

T-7

T-8

T-9

T-10



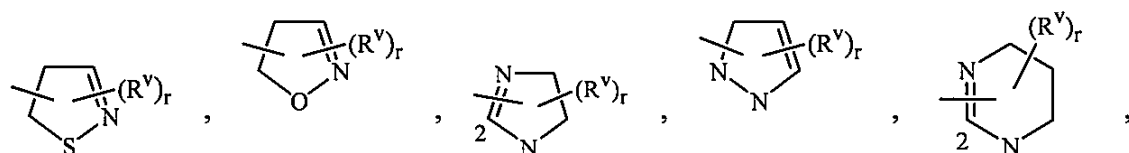
T-11

T-12

T-13

T-14

T-15



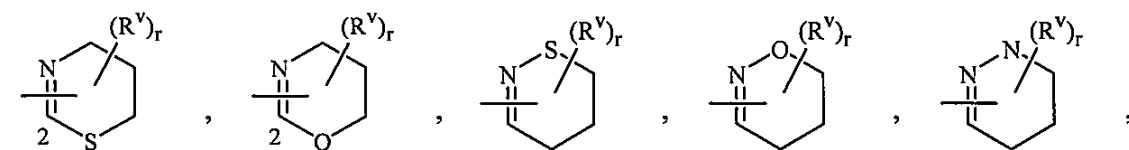
T-16

T-17

T-18

T-19

T-20



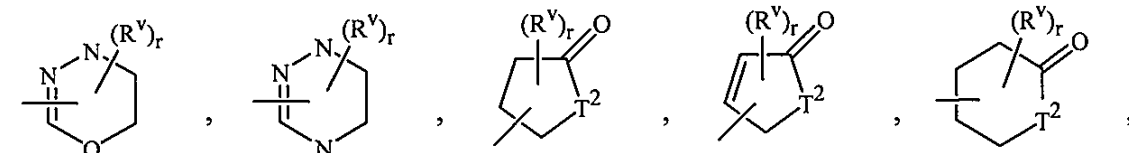
T-21

T-22

T-23

T-24

T-25



T-26

T-27

T-28

T-29

T-30

【 0 0 3 7 】

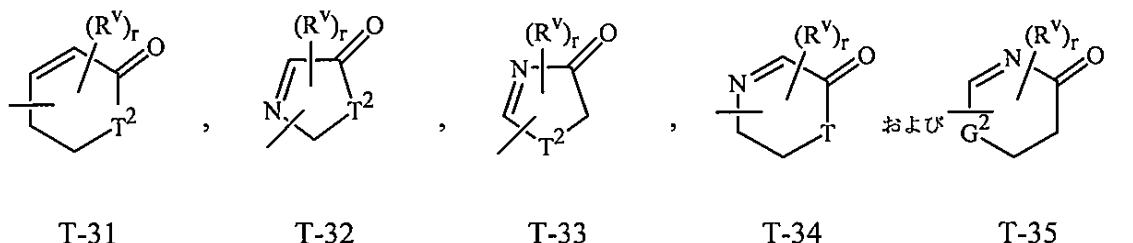
10

20

30

40

【化 7】



【 0 0 3 8 】

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 - 48、および U - 52 ~ U - 61）。

【 0 0 3 9 】

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 巻の *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*、A. R. Katritzky および C. W. Rees 監修、Pergamon Press、Oxford、1984、および全 12 巻の *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。

【 0 0 4 0 】

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）：

【 0 0 4 1 】

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、それらを含む組成物、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。

【 0 0 4 2 】

実施形態 2、 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、ベンジルまたはフェニルである、実施形態 1 の化合物。

【 0 0 4 3 】

実施形態 3、 R^1 は、H、 $C_1 \sim C_7$ 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、 $C_3 \sim C_7$ 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、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルキルチオアルキル、 $C_1 \sim C_7$ アルコキシまたはベンジルである、実施形態 1 または 2 の化合物。

【 0 0 4 4 】

10

20

30

40

50

実施形態 4 . 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る、実施形態 3 の化合物。

【 0 0 4 5 】

実施形態 5 . R^1 は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $NCCCH_2CH_2-$ 、 $C_1 \sim C_2$ 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 . 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る、実施形態 5 の化合物。

【 0 0 4 7 】

実施形態 7 . R^1 は、メチルまたはエチルである、実施形態 6 の化合物。

【 0 0 4 8 】

実施形態 8 . R^1 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 . R^1 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 . R^1 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 】

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。

【 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 】

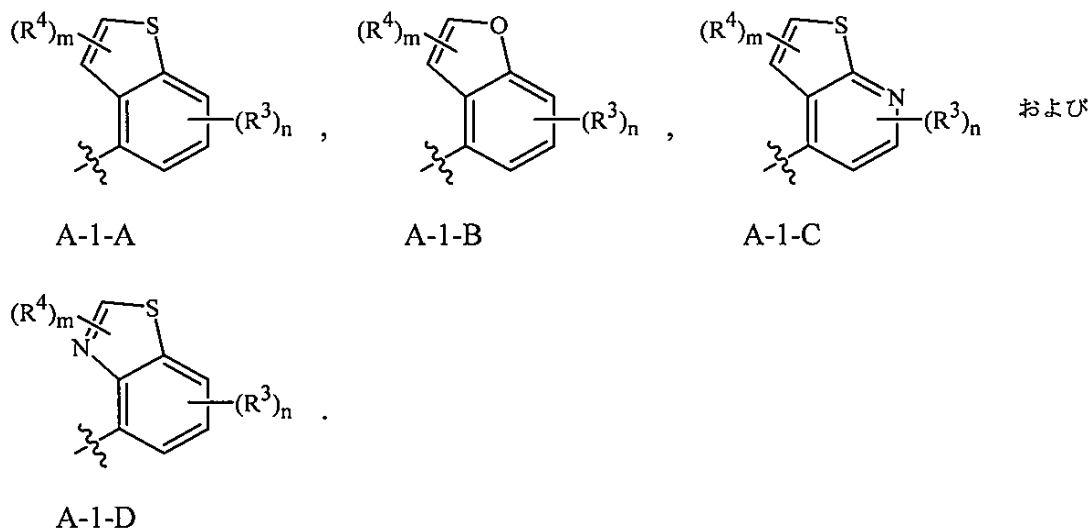
実施形態 19 . A は、

10

20

30

【化 8】



10

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。

20

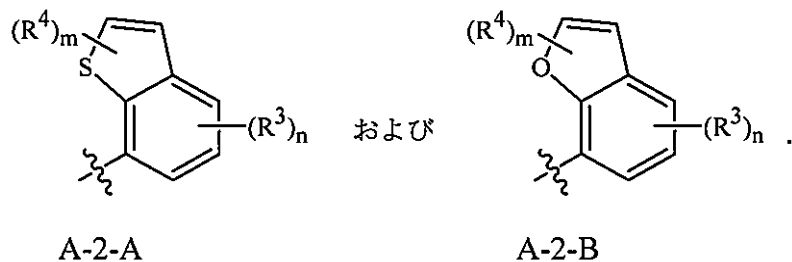
【0061】

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】



30

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、

40

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、

50

実施形態 24 の化合物。

【 0 0 6 7 】

実施形態 27 .

m は、1 であり；

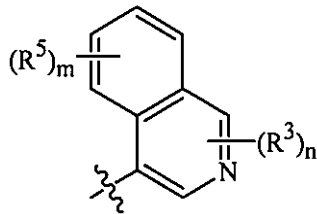
n は、0 である、

実施形態 24 の化合物。

【 0 0 6 8 】

実施形態 28 . A は、

【 化 1 0 】



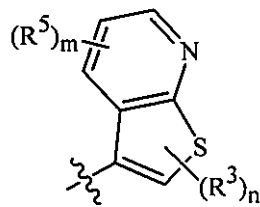
A-3-A

である、実施形態 1 ~ 13、または 17 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 0 6 9 】

実施形態 29 . A は、

【 化 1 1 】



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。

【 0 0 7 0 】

実施形態 30 .

m は、0 または 1 であり；

n は、0 または 1 である、

実施形態 28 または 29 の化合物。

【 0 0 7 1 】

実施形態 31 .

m は、0 であり；

n は、1 である、

実施形態 30 の化合物。

【 0 0 7 2 】

実施形態 32 .

m は、1 であり；

n は、0 である、

実施形態 30 の化合物。

【 0 0 7 3 】

実施形態 33 . G^1 は、H、 $-C(=O)R^7$ 、 $-C(=S)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ 、 $-C(=O)SR^8$ 、 $-CONR^9R^{10}$ もしくは $P(=O)R^{11}$ ；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

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 ~ 32 のいずれか 1 つの化合物。

【0074】

実施形態 34 . G^1 は、 H 、 $-C(=O)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ 、 $-CONR^9R^{10}$ もしくは $P(=O)R^{11}$; 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 . G^1 は、 H 、 $-C(=O)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ もしくは $P(=O)R^{11}$; 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。

10

【0076】

実施形態 36 . G^1 は、 H 、 $-C(=O)R^7$ 、 $-CO_2R^8$; 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 . G^1 は、 H である、実施形態 36 の化合物。

【0078】

実施形態 38 . G^1 は、 $-C(=O)R^7$ である、実施形態 36 の化合物。

【0079】

実施形態 39 . G^1 は、 $-CO_2R^8$ である、実施形態 36 の化合物。

20

【0080】

実施形態 40 . G^1 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 . G^1 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、 G^1 である、実施形態 1 ~ 41 のいずれか 1 つの化合物。

【0083】

実施形態 43 . G は、 W^1G^1 である、実施形態 1 ~ 41 のいずれか 1 つの化合物。

30

【0084】

実施形態 44 . W^1 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 . W^1 は、 $-CH_2-$ または $-CH=CH-$ である、実施形態 44 の化合物。

【0086】

実施形態 46 . W^1 は、 $-CH_2-$ である、実施形態 45 の化合物。

【0087】

実施形態 47 . 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 ~ 46 のいずれか 1 つの化合物。

40

【0088】

50

実施形態 48. R^2 は、H、ハロゲン、-CN、-CHO、 $C_1 \sim C_7$ 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、 $C_1 \sim C_4$ 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、 $C_3 \sim C_7$ 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、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルまたは $C_1 \sim C_7$ アルコキシである、実施形態 47 の化合物。

【0089】

実施形態 49. 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 $C_1 \sim C_3$ アルコキシである、実施形態 48 の化合物。

10

【0090】

実施形態 50. R^2 は、H、ハロゲン、-CN、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、シクロプロピル、 $C_1 \sim C_2$ 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. R^2 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. R^2 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. R^2 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. R^2 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. R^2 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 X^1 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 X^1 は、独立して CR^3 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 X^2 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 X^2 は、独立して CR^3 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 X^3 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。

40

【0101】

実施形態 61. 各 X^3 は、独立して CR^3 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 X^4 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 X^4 は、独立して CR^4 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. X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} 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. X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} は、 $-N=CH-CH=CH-$ として一緒になる（即ち、A-3またはA-4の残部と一緒になって環を形成する）、実施形態1

20

【0110】

実施形態70. X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} は、 $-C(CH_3)=CH-CH=CH-$ 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. X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} 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】

実施形態72. X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} は、 $-CH=CH-C(CH_3)=CH-$ 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。

30

【0113】

実施形態73. Y^1 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. Y^1 は、Oである、実施形態73の化合物。

【0115】

実施形態75. Y^1 は、Sである、実施形態73の化合物。

40

【0116】

実施形態76. Y^2 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. Y^2 は、Oである、実施形態76の化合物。

【0118】

実施形態78. Y^2 は、Sである、実施形態76の化合物。

【0119】

実施形態79. Y^4 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

【 0 1 2 0 】

実施形態 8 0 . Y^4 は、O である、実施形態 7 9 の化合物。

【 0 1 2 1 】

実施形態 8 1 . Y^4 は、S である、実施形態 7 9 の化合物。

【 0 1 2 2 】

実施形態 8 2 . 各 R^3 は、独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ アルコキシである、式 1 または実施形態 1 ~ 8 1 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 1 2 3 】

実施形態 8 3 . 各 R^3 は、独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、シクロプロピルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルである、実施形態 8 2 の化合物。

10

【 0 1 2 4 】

実施形態 8 4 . 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 8 3 の化合物。

【 0 1 2 5 】

実施形態 8 5 . 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 8 4 の化合物。

【 0 1 2 6 】

実施形態 8 6 . 各 R^3 は、独立して H である、実施形態 8 5 の化合物。

【 0 1 2 7 】

実施形態 8 7 . 各 R^4 は、独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ アルコキシである、実施形態 1 ~ 8 6 のいずれか 1 つの化合物。

20

【 0 1 2 8 】

実施形態 8 8 . 各 R^4 は、独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、シクロプロピルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルである、実施形態 8 7 の化合物。

【 0 1 2 9 】

実施形態 8 9 . 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 8 8 の化合物。

【 0 1 3 0 】

実施形態 9 0 . 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 8 9 の化合物。

30

【 0 1 3 1 】

実施形態 9 1 . R^4 は、メチルである、実施形態 9 0 の化合物。

【 0 1 3 2 】

実施形態 9 2 . 各 R^5 は、独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ アルコキシである、実施形態 1 ~ 8 6 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 1 3 3 】

実施形態 9 3 . 各 R^5 は、独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、シクロプロピルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルである、実施形態 9 2 の化合物。

40

【 0 1 3 4 】

実施形態 9 4 . 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 9 3 の化合物。

【 0 1 3 5 】

実施形態 9 5 . 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 9 4 の化合物。

【 0 1 3 6 】

実施形態 9 6 . R^5 は、H である、実施形態 9 5 の化合物。

【 0 1 3 7 】

50

実施形態 97 . R^6 は、H または $C_1 \sim C_3$ アルキルである、実施形態 1 ~ 96 のいずれか 1 つの化合物。

【 0 1 3 8 】

実施形態 98 . R^6 は、H または CH_3 である、実施形態 97 の化合物。

【 0 1 3 9 】

実施形態 99 . R^6 は、 CH_3 である、実施形態 98 の化合物。

【 0 1 4 0 】

実施形態 100 . R^7 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ 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

【 0 1 4 1 】

実施形態 101 . R^7 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルである、実施形態 100 の化合物。

【 0 1 4 2 】

実施形態 102 . 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る、実施形態 101 の化合物。

【 0 1 4 3 】

実施形態 103 . R^7 は、独立して $C_1 \sim C_3$ 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 102 の化合物。

【 0 1 4 4 】

20

実施形態 104 . R^8 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ 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。

【 0 1 4 5 】

実施形態 105 . R^8 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルである、実施形態 104 の化合物。

【 0 1 4 6 】

実施形態 106 . 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る、実施形態 105 の化合物。

【 0 1 4 7 】

30

実施形態 107 . 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 106 の化合物。

【 0 1 4 8 】

実施形態 108 . R^9 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ 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。

【 0 1 4 9 】

実施形態 109 . R^9 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルである、実施形態 108 の化合物。

【 0 1 5 0 】

40

実施形態 110 . R^9 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る、実施形態 109 の化合物。

【 0 1 5 1 】

実施形態 111 . R^{10} は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ 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。

【 0 1 5 2 】

実施形態 112 . R^{10} は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルである、実施形態 111 の化合物。

【 0 1 5 3 】

50

実施形態 113. R^{11} は、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_1 \sim C_3$ 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. R^{11} は、 CH_3 または OCH_3 である、実施形態 113 の化合物。

【0155】

実施形態 115. R^{11} は、 OCH_3 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、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が CH_3 であり、G が G^1 であり、 G^1 が H であり、 X^1 が CBr であり、 X^2 および X^3 がいずれも CH であり、 X^5 が N であり、 X^6 が N である場合、 Y^1 は、 $N - CH_3$ 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、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が Cl であり、G が G^1 であり、 G^1 が H であり、各 X^1 、 X^2 および X^3 が CH であり、 X^5 が N であり、 X^6 が N である場合、 Y^1 は、 $N - CH_3$ 以外である、式 1 の化合物。

【0158】

実施形態 118. A が A - 1 であり、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が CH_3 であり、G が G^1 であり、 G^1 が $-C(=O)R^7$ であり、 R^7 がフェニルであり、 X^1 、 X^2 がいずれも CH であり、 X^3 が CCl であり、 X^5 が CH_3 であり、 X^6 が CH である場合、 Y^1 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、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が Cl であり、G が G^1 であり、 G^1 が H であり、 X^1 、 X^2 、 X^3 が CH であり、 X^5 が N であり、 X^6 が N である場合、 Y^1 は、 $N - CH_3$ 以外である、式 1 の化合物。

【0160】

実施形態 120. A が A - 3 であり、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が H であり、G が G^1 であり、 G^1 が H であり、各 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^7 、 X^9 および X^{10} が CH である場合、 X^8 は、N 以外である、式 1 の化合物。

【0161】

実施形態 121. R^2 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノまたは $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルである、実施形態 47 の化合物。

30

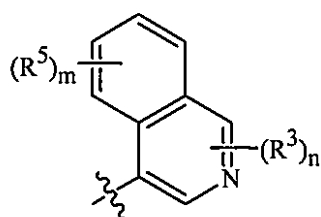
【0162】

実施形態 122. R^2 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノまたは $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノである、実施形態 121 の化合物。

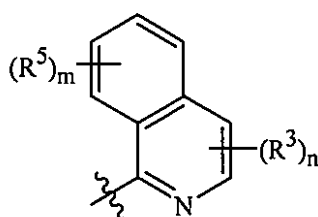
【0163】

実施形態 123. A は、

【化 12】



A-3-A



A-3-B

40

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

50

れか1つの化合物。

【0165】

実施形態125. AがA-4であり; Y⁴がO、SまたはNR⁶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、CR⁵以外である、式1の化合物。

【0166】

実施形態126. AがA-3であり; R¹がCH₃であり; GがHまたはC(=O)CH₃であり; R²がClまたはBrである場合、各X²およびX³は、独立してCR³であり; 各X⁷、X⁸およびX⁹は、独立してCR⁵である、式1の化合物。

【0167】

実施形態127. AがA-3であり; R¹がCH₃であり; GがHまたはC(=O)CH₃であり; R²がCl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CR³であり、R³は、H以外である、式1の化合物。

【0168】

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、

【0169】

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、-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;

10

20

30

40

50

各 R^4 は、独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ アルコキシであり；

各 R^5 は、独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ アルコキシであり；

R^6 は、H または $C_1 \sim C_3$ アルキルであり；

R^7 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^8 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^9 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^{10} は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^{11} は、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_1 \sim C_3$ 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 .

R^1 は、H、 $C_1 \sim C_7$ 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、 $C_3 \sim C_7$ 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、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_7$ アルキルチオアルキル、 $C_1 \sim C_7$ アルコキシまたはベンジルであり；

A は、A - 1 または A - 2 であり；

G^1 は、H、 $-C(=O)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ 、 $-CONR^9R^{10}$ もしくは $P(=O)R^{11}$ ；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り；

W^1 は、 $-CH_2-$ または $-CH=CH-$ であり；

R^2 は、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_7$ 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、 $C_1 \sim C_4$ 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、 $C_3 \sim C_7$ 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、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルまたは $C_1 \sim C_7$ アルコキシであり；

各 X^2 は、独立して CR^3 であり；

各 X^5 は、独立して CR^4 であり；

Y^1 は、O または S であり；

Y^2 は、O または S であり；

各 R^3 は、独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、シクロプロピルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルであり；

各 R^4 は、独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、シクロプロピルまたは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルであり；

R^7 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^8 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

R^9 は、H、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキルであり；

10

20

30

40

50

R^{10} は、 H 、 $C_1 \sim C_7$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$ アルコキシアリルであり；

R^{11} は、 CH_3 または OCH_3 である、
実施形態 A の化合物。

【0171】

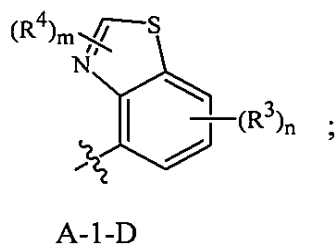
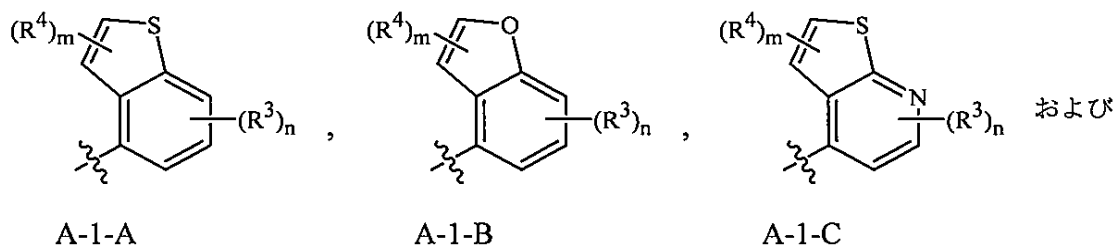
実施形態 C .

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 $C_2 \sim C_4$ アルコキシアリルであり；

A は、

【化13】

10



20

から選択され；

G^1 は、 H 、 $-C(=O)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ もしくは $P(=O)R^{11}$ ；または $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシアリルもしくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；

W^1 は、 $-CH_2-$ であり；

30

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、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシアリルまたは $C_1 \sim C_3$ 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 CF_3 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 CF_3 であり；

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

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

R^{11} は、 OCH_3 である、

実施形態 B の化合物。

【0172】

40

実施形態 D .

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-1-A および A-1-B から選択され；

G は、 G^1 であり；

G^1 は、 H 、 $-C(=O)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ ；または $C_1 \sim C_4$ アルコキシアリルもしくは $C_3 \sim C_6$ 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 $C_2 \sim C_4$ アルコキシアリルであり；

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。

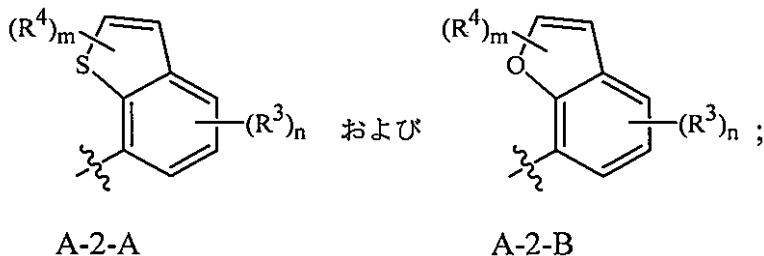
【 0 1 7 3 】

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 1 4 】



10

から選択され；

G^1 は、H、 $-C(=O)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ もしくは $P(=O)R^{11}$ ；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；

20

W^1 は、 $-CH_2-$ 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 CF_3 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 CF_3 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、 OCH_3 である、

30

実施形態 B の化合物。

【 0 1 7 4 】

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、 G^1 であり；

G^1 は、H、 $-C(=O)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ ；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；

40

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、

実施形態 E の化合物。

【 0 1 7 5 】

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) 。

【 0 1 7 6 】

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) 。

【 0 1 7 7 】

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) 。

【 0 1 7 8 】

本発明は更に、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。

【 0 1 7 9 】

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。

【 0 1 8 0 】

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 II 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 II 電子ダイバータ、(b 7) プロトボ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) フィ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) 有糸分裂攪乱物質、有機ヒ素剤、アシュラム、プロモブチド、シンメシリン、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。

【 0 1 8 1 】

「光化学系 II 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 II を介した受け渡し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、ペ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 II 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、ペンタゾン、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、デスメディファム、デスメトリン、ジメフロム、ジメタメトリン、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、メタバズチアズロン、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、ペンタノクロール、フェンメディファム、プロメトン、プロメトリン、プロパニル、プロバジン、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。

【 0 1 8 2 】

「A H A S 阻害剤」(b 2) は、アセト乳酸シンターゼ (A L S) としても公知のアセトヒドロキシ酸シンターゼ (A H A S) 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産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、イマザビル、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] ベンゼンスルホンアミド)、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 - 1 H - ピラゾール - 5 - スルホンアミド)、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、ペノキスラム、プリミスルフロン - メチル、プロボキシカルバゾン - 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 - スルホンアミド)、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ンアミド)、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。

【 0 1 8 3 】

「A C C a s e 阻害剤」(b 3) 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、その後の脂質産生の不足によって、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

10

20

30

40

50

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、プロパキサホップ、キサロホップ、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 およびキサロホップ - 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。

【 0 1 8 4 】

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」(b 4) 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。

【 0 1 8 5 】

「EPSPシンターゼ阻害剤」(b 5) 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。EPSP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選択的な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。

【 0 1 8 6 】

「光化学系Ⅰ電子ダイバータ」(b 6) 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ル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。

【 0 1 8 7 】

「PPO阻害剤」(b 7) 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、ピフェノキス、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 - ペンチル、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。

【 0 1 8 8 】

「 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) およびピ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

【 0 1 8 9 】

「 V L C F A 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、V L C F A の生合成に關与する、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、フルフェナセツト、インダノファン、メフェナセツト、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、プロバクロール、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

【 0 1 9 0 】

「 オーキシシン輸送阻害剤 」 (b 1 0) は、オーキシ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シン輸送を阻害する化学物質である。オーキシ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

【 0 1 9 1 】

「 P D S 阻害剤 」 (b 1 1) 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。P D S 阻害剤の例としては、ベフルプタミド、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。

【 0 1 9 2 】

「 H P P D 阻害剤 」 (b 1 2) は、4 - ヒドロキシフェニル - ビ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。H P P D 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

40

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)、トブラメゾン、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。

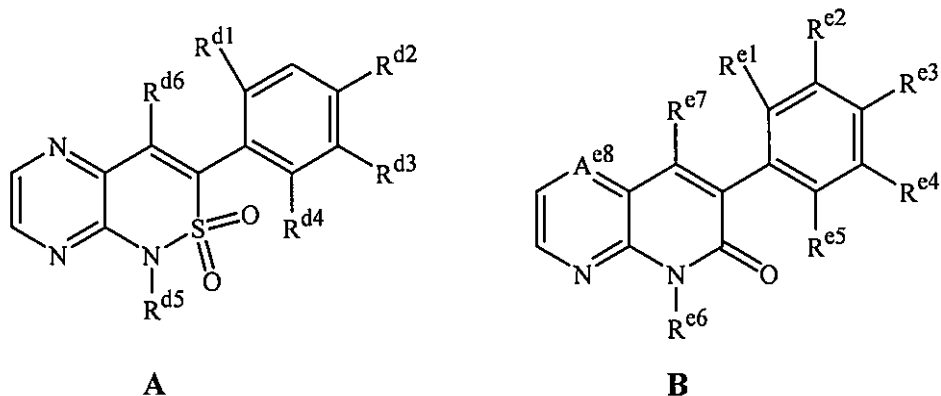
【0193】

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能力を攪乱し、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、Clまたは CF_3 であり； R^{d2} は、H、ClまたはBrであり； R^{d3} は、HまたはClであり； R^{d4} は、H、Clまたは CF_3 であり； R^{d5} は、 CH_3 、 CH_2CH_3 または CH_2CHF_2 であり； R^{d6} は、OHまたは $-OC(=O)-i-Pr$ であって； R^{e1} は、H、F、Cl、 CH_3 または CH_2CH_3 であり； R^{e2} は、Hまたは CF_3 であり； R^{e3} は、H、 CH_3 または CH_2CH_3 であり； R^{e4} は、H、FまたはBrであり； R^{e5} は、Cl、 CH_3 、 CF_3 、 OCF_3 または CH_2CH_3 であり； R^{e6} は、H、 CH_3 、 CH_2CHF_2 または $CH_2CH_2CH_3$ であり； R^{e7} は、OH、 $-OC(=O)Et$ 、 $-OC(=O)-i-Pr$ または $-OC(=O)-t-Bu$ であり； A^8 は、NまたはCHである。)

【0195】

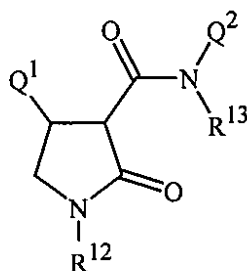
「セルロース生合成阻害剤」(b14)は、特定の植物におけるセルロースの生合成を

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、フルボキサム、インダジフラム (N^2 - [(1R, 2S) - 2, 3 - ジヒドロ - 2, 6 - ジメチル - 1H - インデン - 1 - イル] - 6 - (1 - フルオロエチル) - 1, 3, 5 - トリアジン - 2, 4 - 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 - ジヒドロプ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、イプフェンカルバゾン (1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - N - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 5 - ジヒドロ - N - (1 - メチルエチル) - 5 - オキソ - 4H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 4 - 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 - 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^{12} は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルまたは $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルであり；

R^{13} は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ アルコキシであり；

Q^1 は、フェニル、チエニル、ピリジニル、ベンゾジオキサリル、ナフチル、ナフタレニル、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 R^{14} により置換されており；

Q^2 は、フェニル、ピリジニル、ベンゾジオキサリル、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 R^{15} により置換されており；

各 R^{14} は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_8$ シアノアルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 SF_5 、 NHR^{17} ；または1 ~ 3個の R^{16} によって場合により置換されているフ

エニル；または 1 ～ 3 個の R^{16} 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^{15} は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルであり；
 各 R^{16} は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであり；
 R^{17} は、 $C_1 \sim C_4$ アルコシカルボニルである）。

【0197】

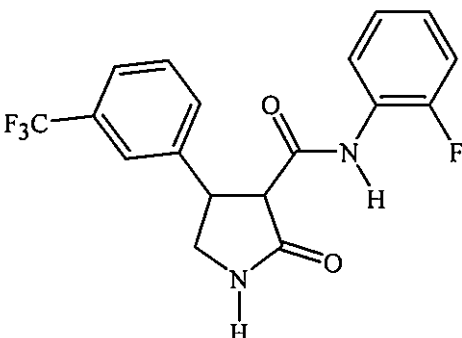
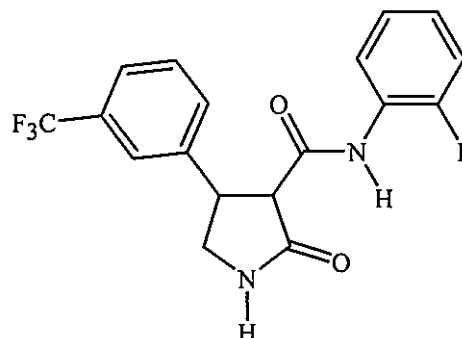
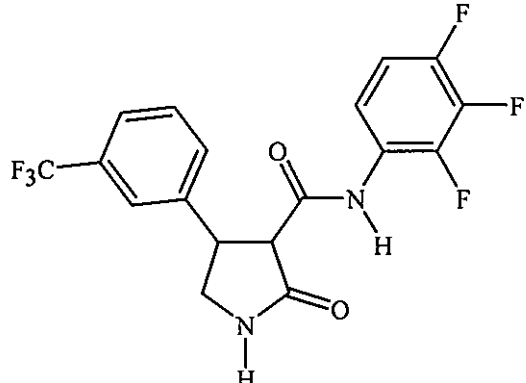
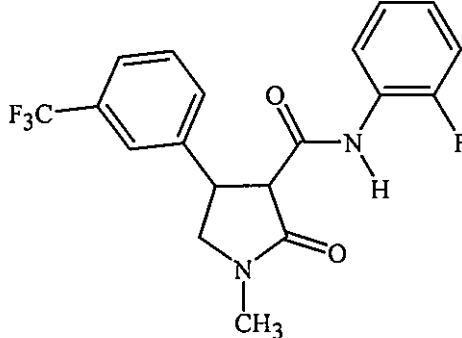
「他の除草剤」(b15) が式 (b15A) の化合物を更に含む一実施形態において、
 R^{12} は、H または $C_1 \sim C_6$ アルキルであることが好適であり；より好ましくは、 R^{12} は、H またはメチルである。好ましくは、 R^{13} は、H である。好ましくは、 Q^1 は、フェニル環またはピリジニル環のいずれかであり、各環は、1 ～ 3 個の R^{14} により置換されており；より好ましくは、 Q^1 は、1 ～ 2 個の R^{14} により置換されているフェニル環である。好ましくは、 Q^2 は、1 ～ 3 個の R^{15} により置換されているフェニル環であり；より好ましくは、 Q^2 は、1 ～ 2 個の R^{15} 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^{14} は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシであり；より好ましくは、各 R^{14} は、独立してクロロ、フルオロ、プロモ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシまたは $C_1 \sim C_2$ アルコキシである。好ましくは、各 R^{15} は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシであり；より好ましくは、各 R^{15} は、独立してクロロ、フルオロ、プロモ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシまたは $C_1 \sim C_2$ 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】

10

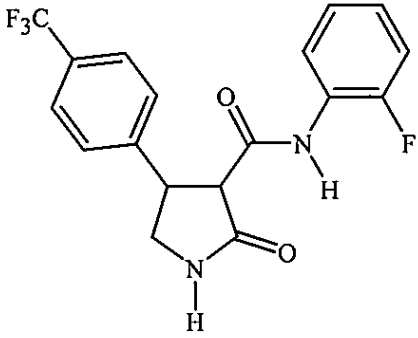
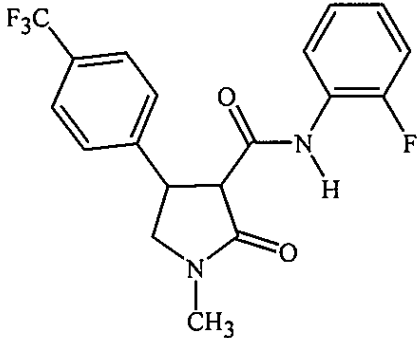
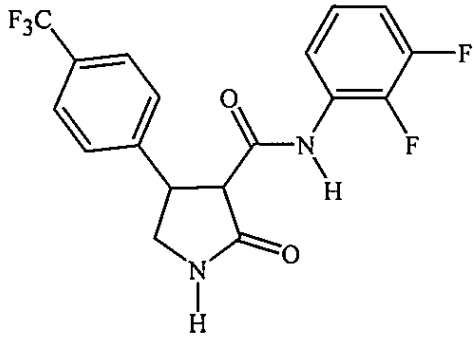
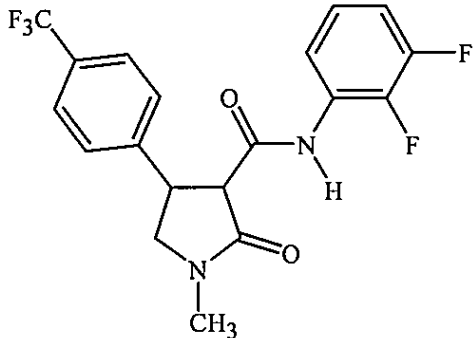
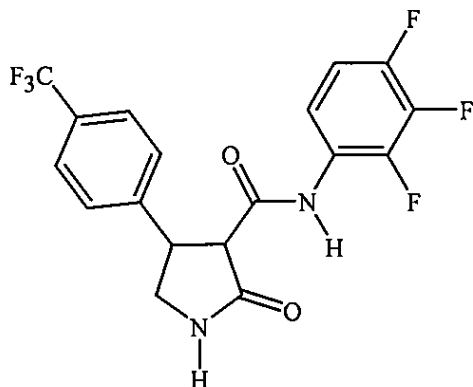
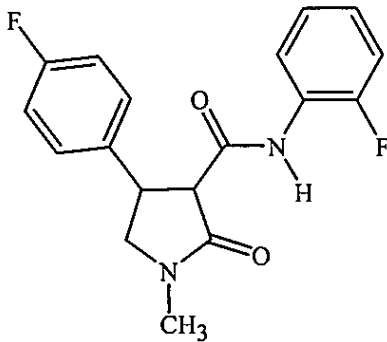
20

【表 1】

	
(b15A-1)	(b15A-2)
	
(b15A-3)	(b15A-4)

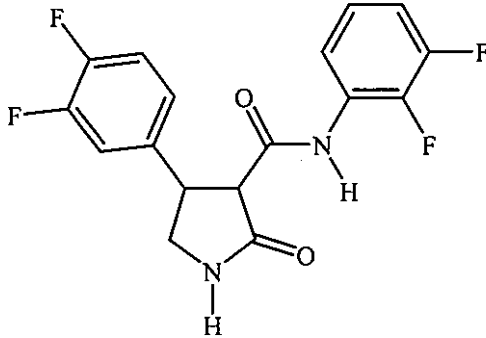
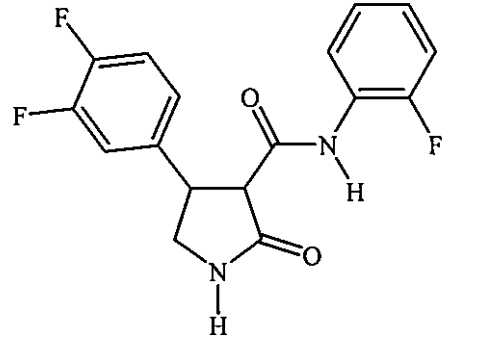
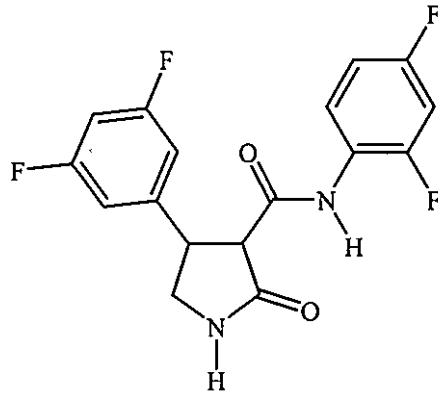
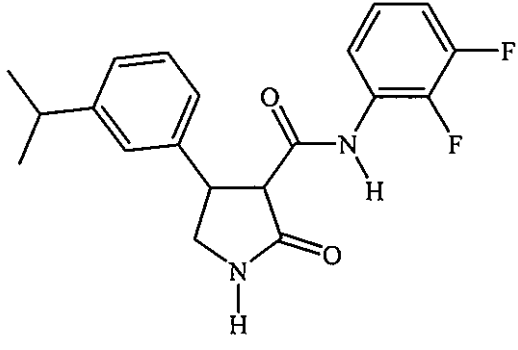
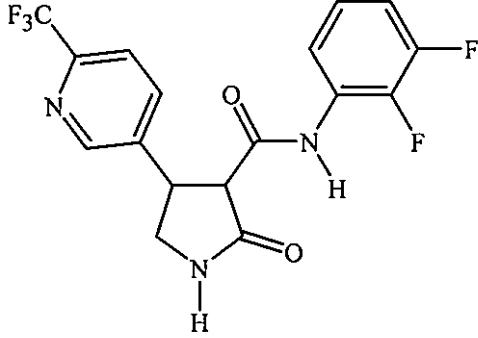
【 0 1 9 9 】

【表 2】

		10
(b15A-5)	(b15A-6)	
		20
(b15A-7)	(b15A-8)	
		30
(b15A-9)	(b15A-10)	40

【 0 2 0 0 】

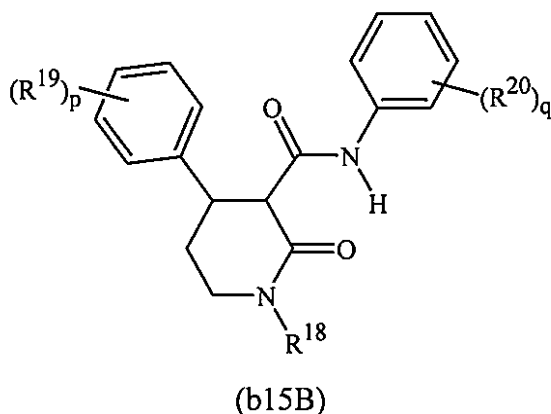
【表 3】

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

【 0 2 0 1 】

「他の除草剤」(b 1 5)は、式(b 1 5 B)の化合物を更に含む

【化 17】



10

(式中、

R^{18} は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルまたは $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルであり；

各 R^{19} は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_6$ 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；

20

各 R^{20} は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_6$ 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】

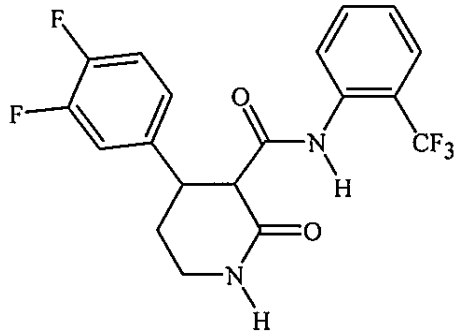
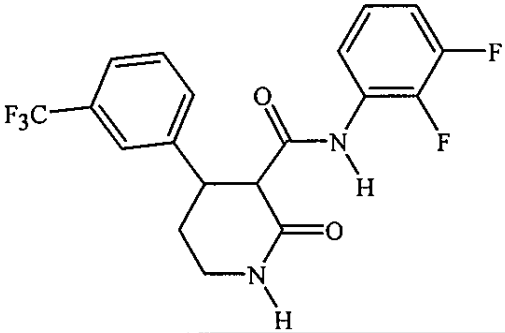
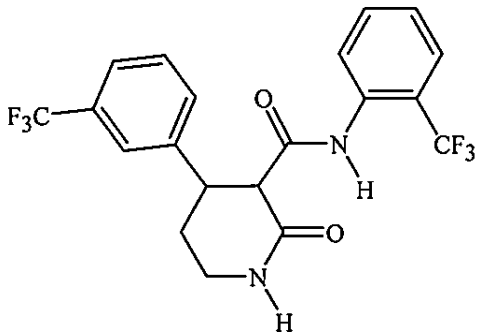
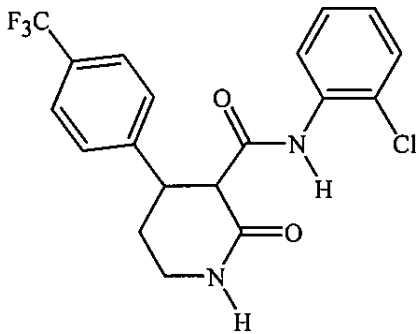
「他の除草剤」(b15) が式 (b15B) の化合物を更に含む一実施形態において、 R^{18} は、H、メチル、エチルまたはプロピルであることが好適であり；より好ましくは、 R^{18} は H またはメチルであり；最も好ましくは、 R^{18} は H である。好ましくは、各 R^{19} は、独立してクロロ、フルオロ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシであり；より好ましくは、各 R^{19} は、独立してクロロ、フルオロ、 C_1 フルオロアルキル（即ち、フルオロメチル、ジフルオロメチルもしくはトリフルオロメチル）または C_1 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^{20} は、独立してクロロ、フルオロ、 C_1 ハロアルキルまたは C_1 ハロアルコキシであり；より好ましくは、各 R^{20} は、独立してクロロ、フルオロ、 C_1 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 C_1 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：

30

【0203】

40

【表 4】

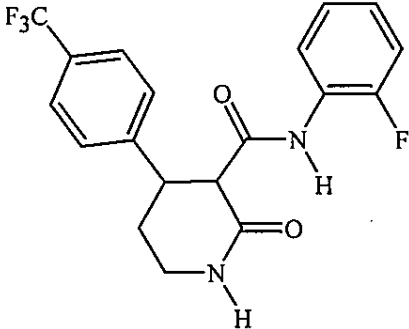
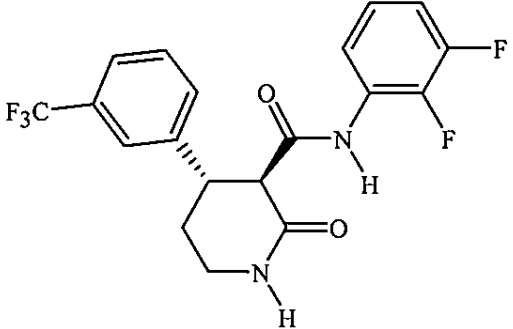
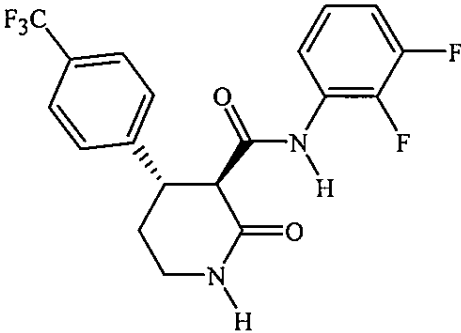
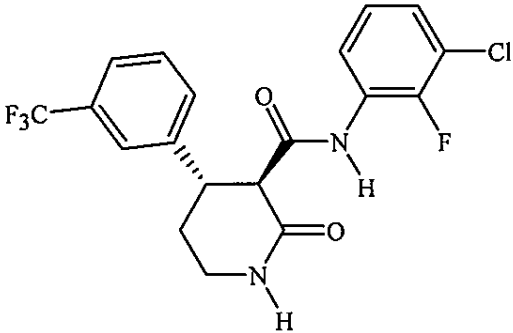
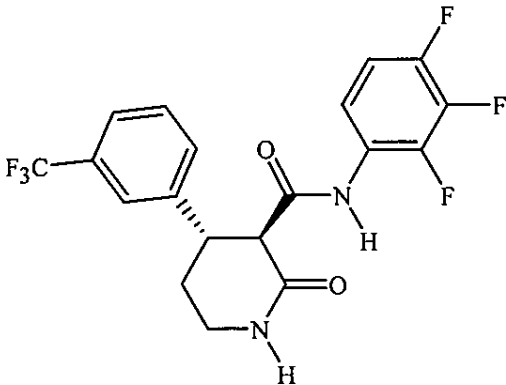
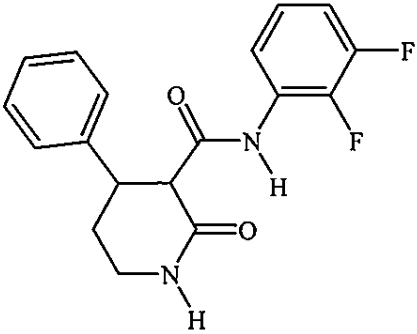
	
(b15B-1)	(b15B-2)
	
(b15B-3)	(b15B-4)

10

20

【 0 2 0 4 】

【表 5】

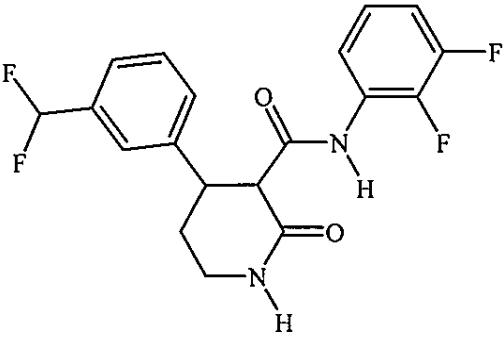
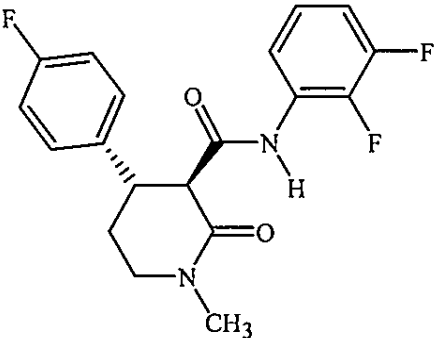
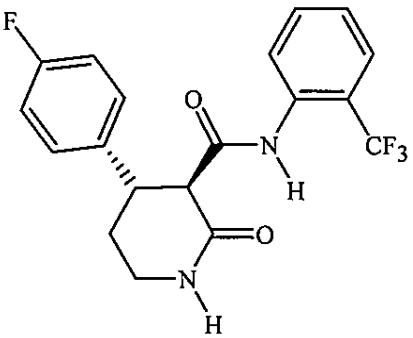
	
(b15B-5)	(b15B-6)
	
(b15B-7)	(b15B-8)
	
(b15B-9)	(b15B-10)

【表 6】

(b15B-11)	(b15B-12)
(b15B-13)	(b15B-14)
(b15B-15)	(b15B-16)

【 0 2 0 6 】

【表 7】

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

10

20

【 0 2 0 7 】

「除草剤薬害軽減剤」(b 1 6)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、ペノキサコール、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、ジクロロミド、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ンアミドおよびN - (アミノカルボニル) - 2 - フルオロベンゼンスルホンアミド、1 - プロモ - 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 - アゾスピロ[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 - [[4 - [(メチルアミノ)カルボニル]アミノ]フェニル]スルホニル] - ベンズアミドが挙げられるが、これらに限定されない。

30

40

【 0 2 0 8 】

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 1 a、1 b および 1 c は、式 1 の化合物の部分集合であり、式 1 a、1 b および 1 c に係る全ての置換基は、特に断りのない限り式 1 につ

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。

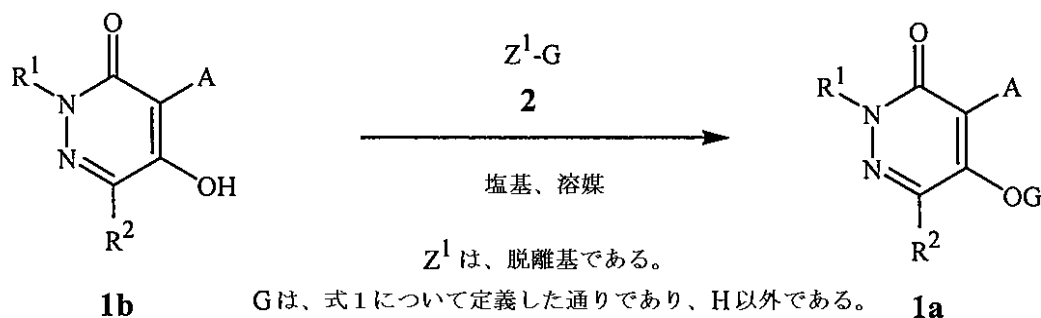
【0209】

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、 $Z^1 - G$ 、式中、 Z^1 は、ハロゲンのようなヌクレオフュージ (nucleofuge) 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。 Z^1 は Cl 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 $-(C=O)R^7$)、クロロホルマート (G は $-CO_2R^8$)、カルバモイルクロリド (G は $-CONR^9R^{10}$)、スルホニルクロリド (G は $-S(O)_2R^7$)、およびクロロスルホンアミド (G は $-S(O)_2NR^9R^{10}$) 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 tert - ブ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、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 - ジメ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。

【0210】

【化18】

スキーム 1



【0211】

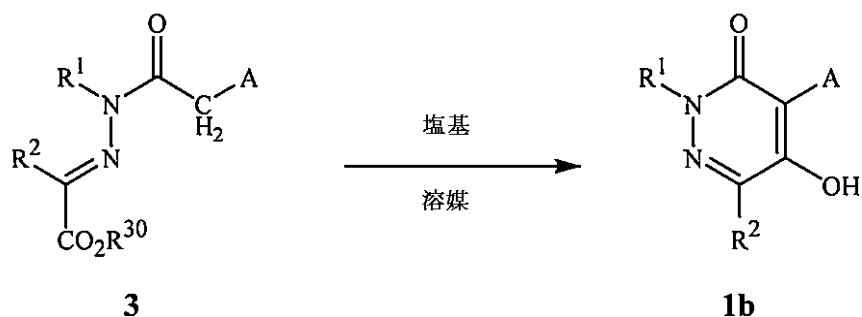
式 1 b の置換された 5 - ヒドロキシ - 3 (2 H) - ピリダジノンは、スキーム 2 に概説するように、塩基および溶媒の存在下、式 3 のヒドラジドエステル (式中、 R^{30} はアルキル、典型的にはメチルまたはエチルである) の環化によって製造することができる。この反応に適する塩基としては、炭酸カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、カリウム t - ブトキシド、または 1, 8 - ジアザビシクロ [5.4.0] ウンデカ - 7 - エンが挙げられるが、これらに限定されない。使用される特定の塩基に応じ、適切な溶媒はプロトン性または非プロトン性とすることができ、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 $CH_3(CO_2C_2H_5)C=NNCH_3C(=O)CH_2Ar$ (式中、Ar 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。

【0212】

【化19】

スキーム2



10

【0213】

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、R³⁰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なることができ、ここで、反応は、無水条件下で、またはショットテン・バ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る。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。

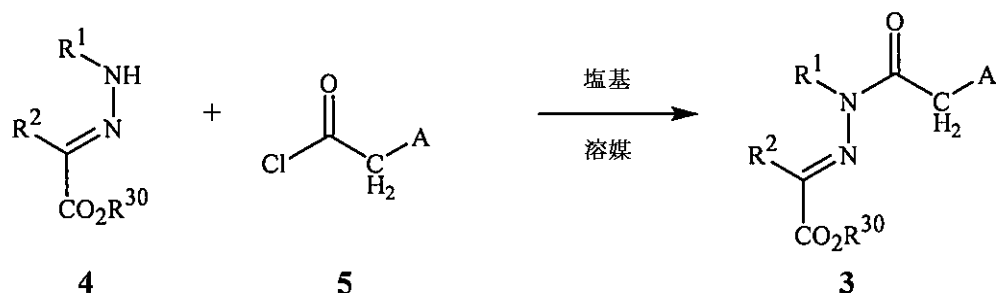
20

30

【0214】

【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^1NHNH_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2007/0112038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】

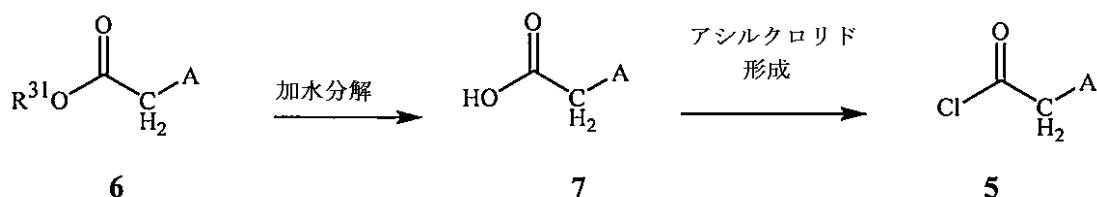
スキーム4に示すように、式5の二環式アセチルクロリドは、 R^{31} は典型的にはメチルまたはエチルである式6の対応する二環式酢酸エステルから、エステル加水分解および酸クロリド形成によって製造することができる。この変換のための標準的な方法は、文献において公知である。例えば、エステル加水分解は、式6のエステルのアルコール溶液をアルカリ金属水酸化物の水溶液と共に加熱し、続いて鉱酸で酸性化することにより達成可能である。次いで、形成された式7のカルボン酸を、ジクロロメタンのような不活性溶媒中、オキサリルクロリドと触媒量のN,N-ジメチルホルムアミドで処理することにより、式5の対応するアシルクロリドに変換することができる。J. Heterocycl. 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。Monatsh. Chem. 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のビスクロフランアセタート（即ち、 Y^4 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

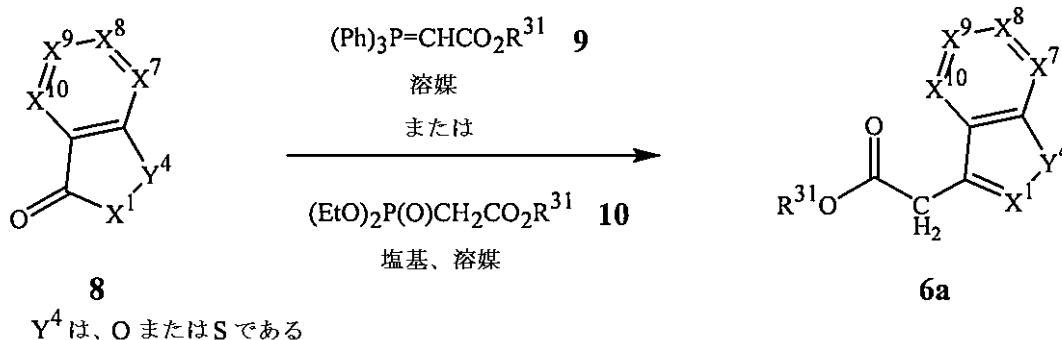
50

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）アセタートとのウィ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 *tert*-ブトキシドのような塩基の存在下、 R^{31} 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。ウィ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



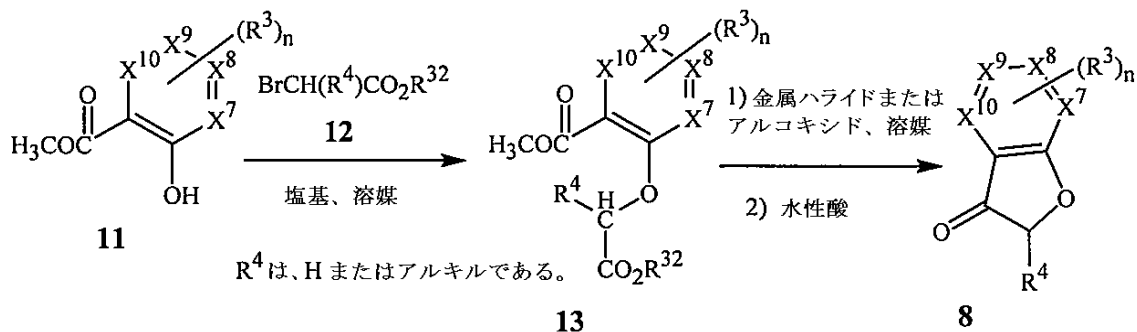
【 0 2 2 0 】

スキーム 6 に示すように、 R^4 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、 R^{32} 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



10

【0 2 2 2】

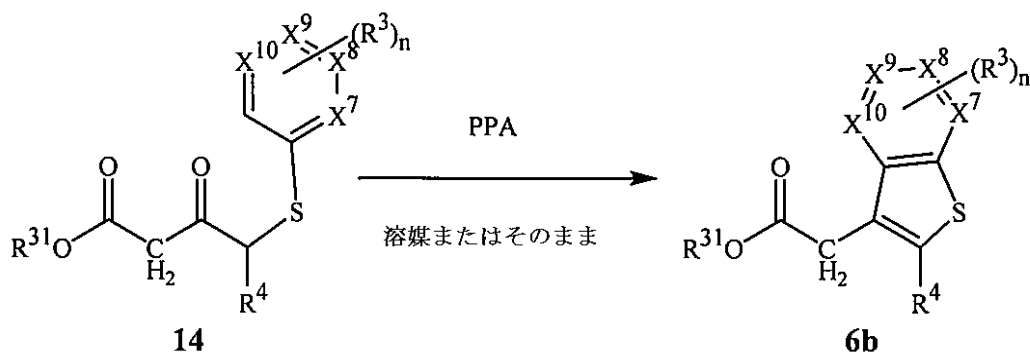
スキーム 7 に図示するように、 R^4 は水素またはアルキルである式 6 b の置換された二環式チオフェン（即ち、 X は S である式 6）は、式 1 4 の適切に置換されたフェニルチオケトエステルを、一般には、酸性条件下、好ましくはポリリン酸（PPA）をそのまま、または不活性な概して高沸点の溶媒、例えば、クロロベンゼン、キシレンまたはトルエン中で用いて環化することによって、容易に入手可能である。クロロベンゼンが好適な溶媒である。クロロベンゼン中で PPA を使用するこの環化の文献例については、J . H e t e r o c y c l i c C h e m . 1 9 8 8、2 5、1 2 7 1 ~ 1 2 7 2 を参照されたい。

20

【0 2 2 3】

【化 2 4】

スキーム 7



30

【0 2 2 4】

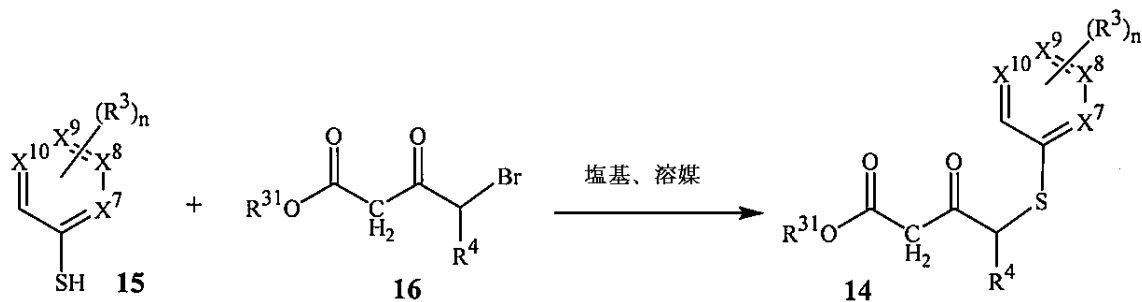
スキーム 8 に示すように、J . H e t e r o c y c l i c C h e m . 1 9 8 8、2 5、1 2 7 1 ~ 1 2 7 2 および米国特許第 5 3 7 6 6 7 7 号においても教示されている方法により、溶媒中、塩基の存在下、式 1 6 の 4 - プロモ - 1 , 3 - ケトエステル（即ち、 $\text{R}^4\text{CHBr(C=O)CH}_2\text{CO}_2\text{R}$ 、式中、 R は、一般にメチルまたはエチルである）で式 1 5 のチオ複素環をアルキル化することによって、式 1 4 の置換された 4 - フェニルチオ - 1 , 3 - ケトエステル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。

40

【0 2 2 5】

【化 2 5】

スキーム 8



10

【0 2 2 6】

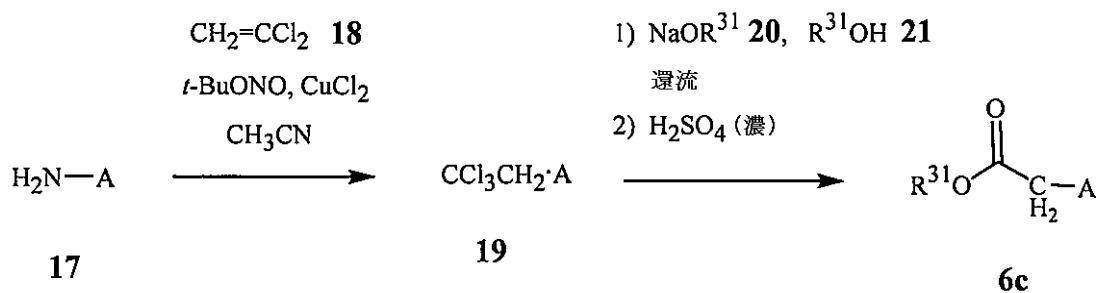
スキーム 9 に示すように、式 6 c のヘテロアリール酢酸誘導体（即ち、X は $-\text{C}(\text{R}^6) = \text{C}(\text{R}^7)-$ である式 6）は、式 17 の適切に置換されたヘテロアリールアミンから製造することができる。この方法によれば、1, 1 - ジクロロエテン（18）の存在下、式 17 のアミンがジアゾ化（好ましくは、アセトニトリル中塩化第二銅の存在下、亜硝酸 t - ブチルで）され、式 19 の対応するトリクロロエチル複素環が得られる。次いで、式 21 のアルコールのような適切な溶媒中、式 19 のトリクロロエチル複素環を式 20 のナ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 6 c 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。

20

【0 2 2 7】

【化 2 6】

スキーム 9



30

【0 2 2 8】

式 6 c 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 - ブロモコハク酸イミド（NBS）で臭素化して式 23 のヘテロアリールメチルブ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、シアン化カリウム）と反応させることによって臭素をシアン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 6 c 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 R^{31}OH は、低級アルカノールである。

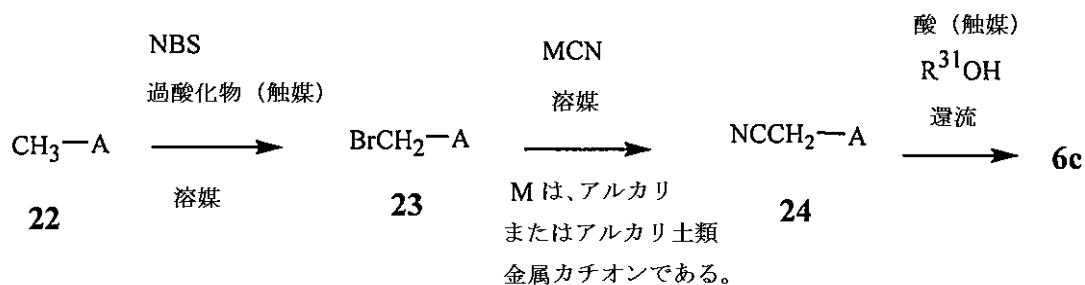
40

【0 2 2 9】

50

【化 27】

スキーム 10



10

【0230】

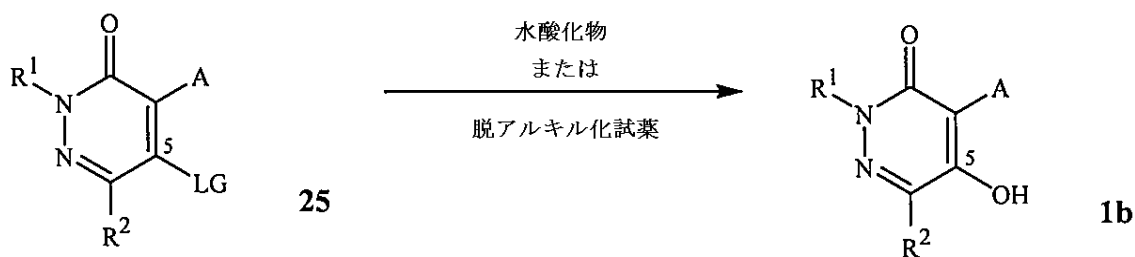
ピリダジノン環の5位の脱離基の加水分解を、スキーム11に示すように達成することができる。LG基が低級アルコキシ、低級アルキルスルフィド（スルホキシドまたはスルホン）、ハライド、またはN-結合アゾールである場合、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、またはジオキサンのような溶媒中、0～120の温度での水酸化テトラブチルアンモニウムのような塩基性試薬による加水分解によって除去することができる。この加水分解に有用な他の水酸化物試薬としては、水酸化カリウム、水酸化リチウムおよび水酸化ナトリウムが挙げられる（例えば、WO2009/086041を参照されたい）。

20

【0231】

【化 28】

スキーム 11



30

【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

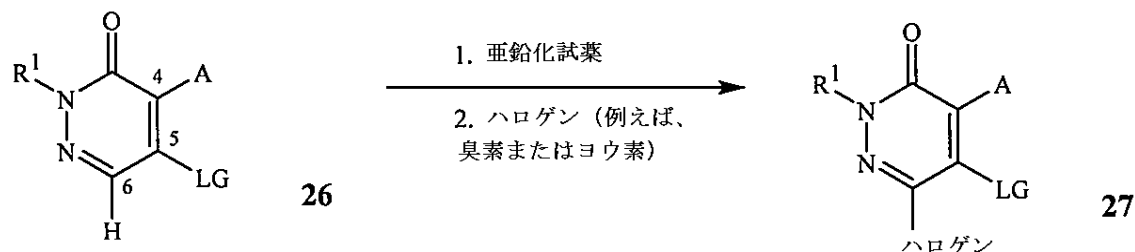
50

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WO2008/138946およびWO2010/092096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、 R^2 はハロゲンまたはスルホナートである)の化合物の R^2 置換基は更に、他の官能基に変換可能である。 R^2 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。ブッフバルト・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。

20

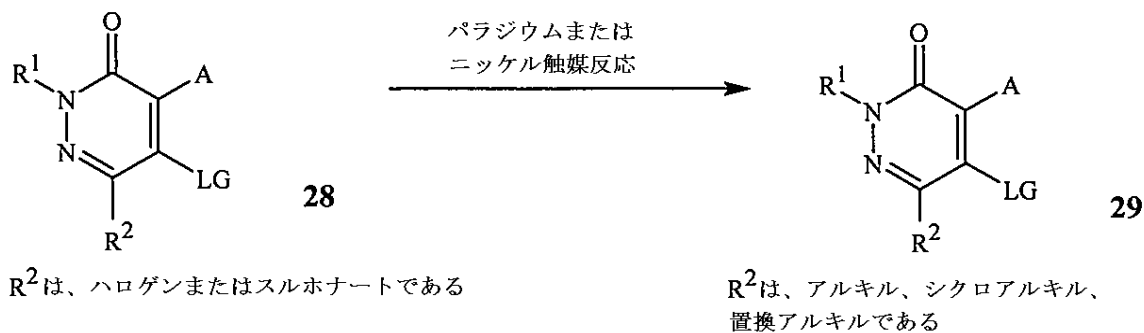
30

【0235】

40

【化 30】

スキーム 13



10

【0236】

式 30 a 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 Beller, 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, 12898 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。

20

【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 30 a 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（スティール反応）、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ャール交換反応（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。

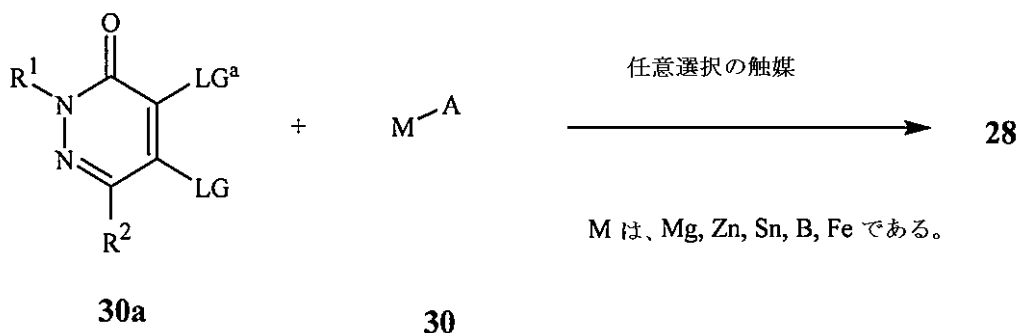
30

40

【0238】

【化 3 1】

スキーム 14



10

【0239】

式 30a の化合物は、当技術分野で公知であるか、Maes および Lemiere、Comprehensive Heterocyclic Chemistry III Volume 8、Katritsky, Ramsden, Scrive 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；WO2009/086041 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；WO2013/160126；ならびに WO2013/050421 にも記載されている。

20

【0240】

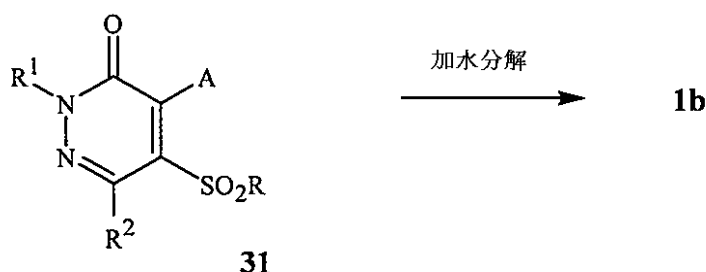
式 1b の化合物は、水性塩基中での式 31 のスルホンの加水分解によっても製造可能である。適する塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、または水酸化テトラブチルアンモニウムが挙げられる。典型的な反応温度は、0～80 の範囲であり、典型的な反応時間は 1～12 時間である。この方法をスキーム 15 に示す。

【0241】

30

【化 3 2】

スキーム 15



40

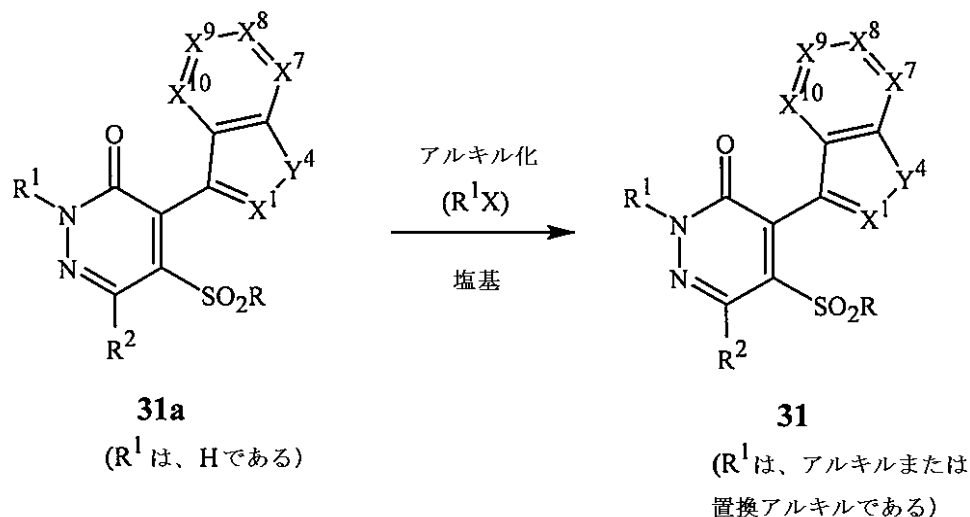
【0242】

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 3 3】

スキーム 16



10

【 0 2 4 4 】

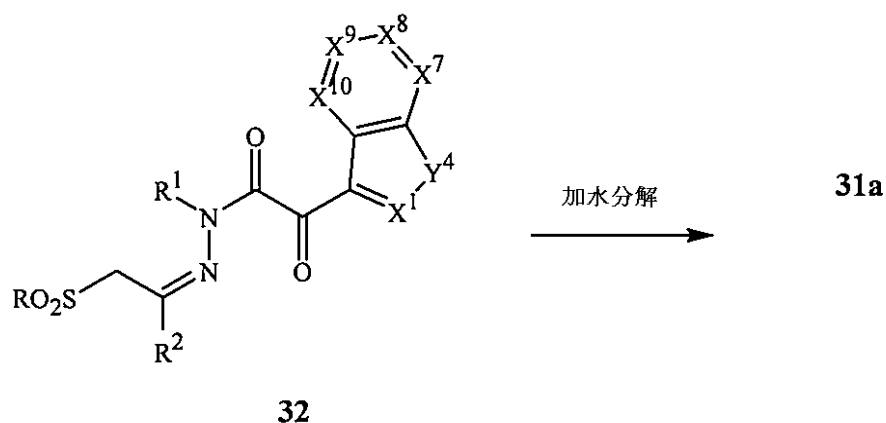
式 3 1 a の化合物は、塩基での処理による式 3 2 の化合物の環化によって製造可能である。この方法に有用な典型的な塩基としては、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、または炭酸セシウムが挙げられる。典型的な溶媒としては、スキーム 1 7 に示すように、アセトニトリル、テトラヒドロフランまたは N , N - ジメチルホルムアミドが挙げられる。

20

【 0 2 4 5 】

【化 3 4】

スキーム 17



30

【 0 2 4 6 】

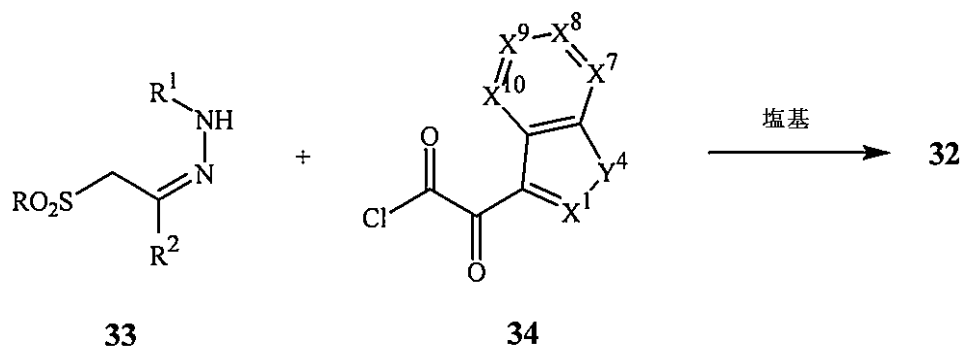
式 3 2 の化合物は、スキーム 1 8 に示す方法によって製造可能である。この方法において、式 3 3 の化合物は、塩基の存在下で式 3 4 の化合物とカップリングされる。この方法に有用な塩基としては、トリエチルアミン、炭酸ナトリウムもしくは炭酸カリウム、ピリジン、またはジイソプロピルエチルアミンが挙げられる。

40

【 0 2 4 7 】

【化 3 5】

スキーム 18



10

【 0 2 4 8】

式 3 3 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。

【 0 2 4 9】

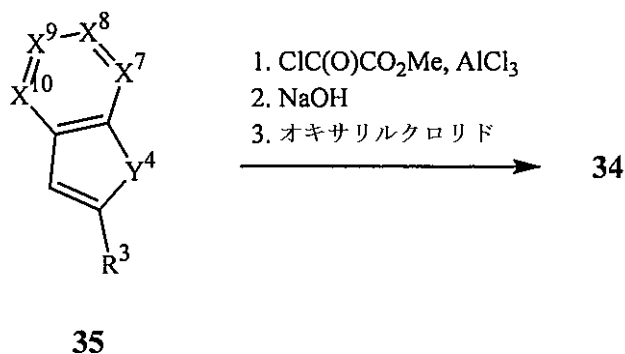
式 3 4 の化合物は、幾つかの方法によって製造可能である。スキーム 1 9 に示す一方法においては、三塩化アルミニウムの存在下で式 3 5 の化合物をまず $\text{ClC}(\text{O})\text{CO}_2\text{Me}$ で処理する。その後のカルボン酸への加水分解とそれに続くオキサリルクロリドでの処理により、式 3 4 のアシルクロリドが得られる。

20

【 0 2 5 0】

【化 3 6】

スキーム 19



30

【 0 2 5 1】

式 3 5 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。

【 0 2 5 2】

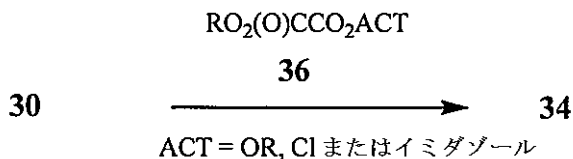
式 3 4 の化合物は、ヘテロ芳香族有機金属試薬と式 3 6 の活性シュウ酸エステルとの反応によっても製造可能である。活性化基は、アルキルエステル、ハロゲン、またはイミダゾールとすることができる。金属は、リチウムまたはマグネシウムとすることができる。パラジウム触媒を利用する場合は、亜鉛およびスズのような他の金属基を使用してもよい。

40

【 0 2 5 3】

【化 3 7】

スキーム 20



【 0 2 5 4 】

10

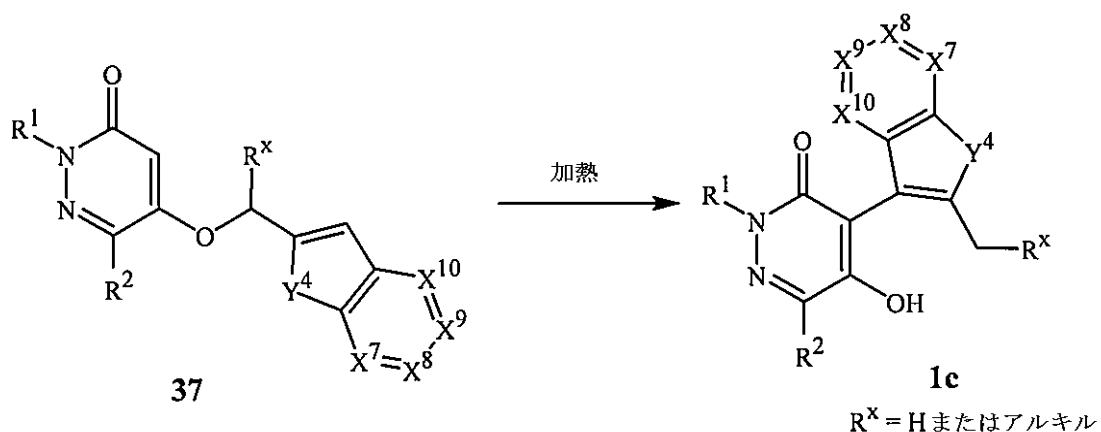
スキーム 21 に示すように、式 1 c の化合物は、式 3 7 の化合物の転位によって製造可能である。この転位は、110 と 300 の間の温度で実行可能である。適する溶媒としては、キシレン、ジエチルベンゼン、およびメシチレンのような芳香族炭化水素、ならびにジクロロベンゼンのようなハロゲン化芳香族化合物が挙げられるが、これらに限定されない。Dowtherm A およびジグリムのような他の高沸点溶媒を採用することも好都合である。特に、イオン性液体を媒体に添加する場合は、沸点がより低い他の多くの溶媒をマイクロ波加熱と併用することができる。

【 0 2 5 5 】

【化 3 8】

スキーム 21

20



30

【 0 2 5 6 】

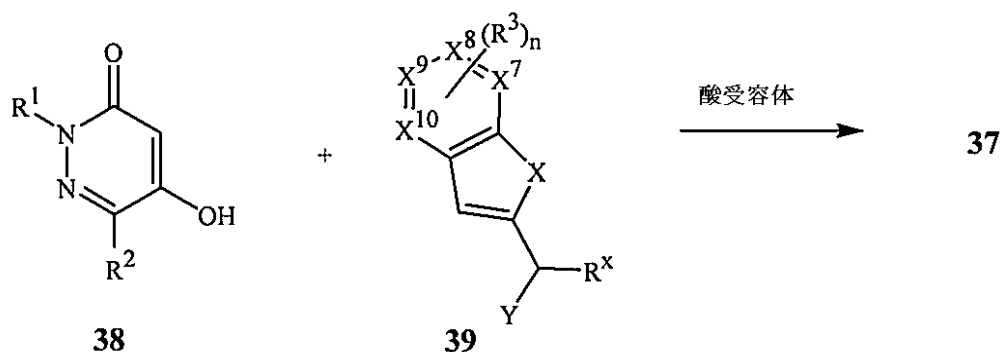
式 3 7 の化合物は、スキーム 22 に示すように、式 3 8 のピリダジノンを式 3 9 のハロゲン化アルキルでアルキル化することにより製造可能である。反応は、アセトン、2-ブタノン、アセトニトリル、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリジノン、ジメチルスルホキシド、およびジメチルホルムアミドのような種々の溶媒中で実施できる。限定されるものではないが、炭酸セシウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、水酸化カリウム、または水酸化ナトリウムのような酸受容体の存在が好適である。脱離基 Y は、ハロゲンまたはスルホナートとすることができる。

40

【 0 2 5 7 】

【化 3 9】

スキーム 22



10

【 0 2 5 8】

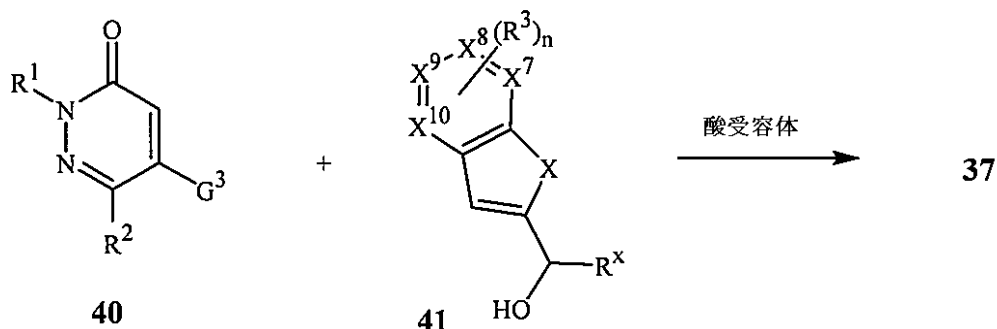
式 37 の化合物は、スキーム 23 に示すように、式 40 のピリダジノンと式 41 のアルコールとの求核置換反応によっても製造可能である。適する溶媒としては、ジオキサン、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジメチルアセトアミド、N - メチルピロリジノン、ジメチルスルホキシド、およびジメチルホルムアミドが挙げられる。適する酸受容体としては、水素化ナトリウム、水素化カリウム、カリウム t - ブトキシド、ナトリウムヘキサメチルジシラジド、カリウムヘキサメチルジシラジド、およびリチウムヘキサメチルジシラジドが挙げられるが、これらに限定されない。

20

【 0 2 5 9】

【化 4 0】

スキーム 23



30

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

【 0 2 6 0】

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る。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 Pd_2dba_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ピ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

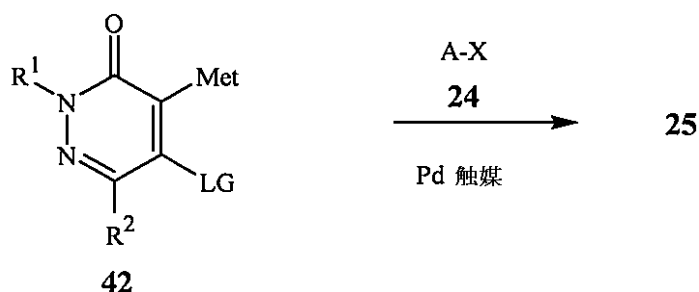
- Pent のような N - 複素環式カルベンリガンドに由来するプレ触媒 (Organら、Eur. J. Org. Chem. 2010、4343 ~ 4354) も、このカップリングに影響を及ぼすことができる。反応は、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、N - メチル - 2 - ピロリドン、およびジオキサンのような溶媒中で実行可能である。カップリングパートナーは、複素環式ハライドまたはスルホナートのいずれかであり得る。反応に特に有用なカップリングパートナーのクラスは、ヘテロ芳香族化合物のノナフラート ($\text{OSO}_2\text{C}_4\text{F}_9$) に基づくものである。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

10

【0261】

【化41】

スキーム 24



20

【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、 $\text{Zn(TMP)} - \text{LiCl}$ または $\text{Zn(TMP)}_2 - \text{MgCl}_2 - \text{LiCl}$) のような亜鉛化試薬を用いて達成可能である。

30

【0263】

この位置のマグネシウム化(magnesi ation)は、 $\text{Mg(TMP)} - \text{LiCl}$ 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。

40

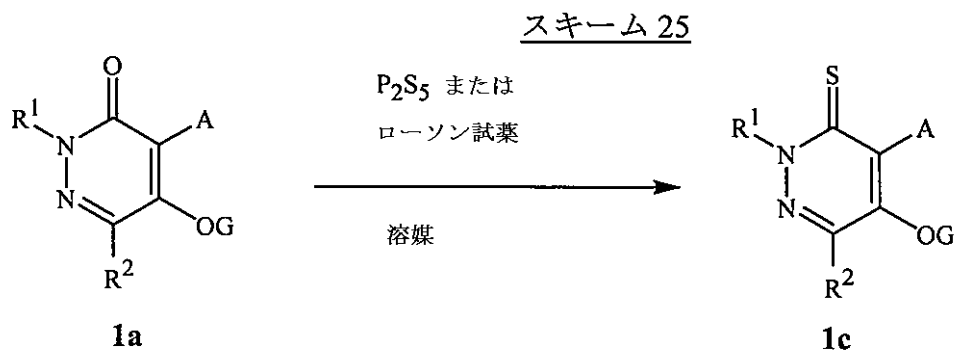
【0264】

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】

50

【化 4 2】



10

【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いてもよく、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。

20

【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。そ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、場合によっては、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。

30

【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可能である。

40

【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 ($\text{M} + 1$) の分子量、または、分子からの H^+ (分子量 1

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400MHz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 (2 H) - ピリダジノン (化合物 12) の製造 10

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

2 - ブロモフェノール (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), 7.56 (d, 1H). 20

【0271】

工程 B : 7 - ブロモ - 2 - メチル - ベンゾフランの製造

1 - ブロモ - 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 (2 H) - 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 (2 H) - 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 - LiCl - 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 (2 H) - ピリダジノンの製造

1 , 4 - ジオキサソ (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、9.86 mmol) に、ナトリウムメトキシド (メタノール中25% w/w 溶液、2.72 mL、12.63 mmol) 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 NH_4Cl 水溶液でクエンチし、酢酸エチル (100 mL、次いで50 mL) 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 (20 mL) 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、6.66 mmol)、トリメチルボロキシン (1.21 mL、8.66 mmol)、炭酸セシウム (6.50 g、19.9 mmol)、[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 (II) (0.27 g、0.33 mmol) 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 (40 mL、次いで20 mL) 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) (1.0 g、4.73 mmol) 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2.5 M、3.34 g、5.68 mmol) 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 NH_4Cl 溶液でクエンチし、続いて酢酸エチル (3 x 10 mL)、次いでブライン溶液で抽出し、 Na_2SO_4 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 250 mg 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) (200 mg、0.69 mmol) の1 , 4 - ジオキサン (2 mL) 溶液に、水酸化テトラブチルアンモニウム (1 mL) 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 (3 mL) で希釈し、1 N 塩酸溶液で pH = 3 に酸性化した。水層をジクロロメタン (3 x 5 mL) で抽出し、ブライン溶液で洗浄し、次いで、 Na_2SO_4 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 (90 mg) 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 で添加した。得られた混合物を 0 で 4 時間撹拌した。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 x 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 で 10 分間滴加した。得られた混合物を -78 で 1 時間撹拌し、次いで、ヨードメタン (11.13 g、78.9 mmol) を添加し、混合物を -78 で撹拌し、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 x 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) を周囲温度で少しずつ添加し、2 時間撹拌した。トリエチルホスホノアセタートを周囲温度で添加し、10 分間撹拌し、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 で 16 時間撹拌した。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 x 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)

のトルエン (1 5 0 m L) 溶液に、 2 , 3 - ジクロロ - 5 , 6 - ジシアノ - 1 , 4 - ベンゾキノン (D D Q 、 1 6 . 8 g 、 7 4 . 1 5 m m o l) を周囲温度で添加し、得られた混合物を 1 0 0 で 2 4 時間撹拌した。次いで、反応混合物を C e l i t e (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 . 5 g) を単離した。M . S . = 2 3 5 (M + H) 。

【 0 2 8 1 】

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 、 2 5 m L) の溶液に、水酸化リチウム (1 g 、 4 2 . 7 m m o l) を添加し、得られた混合物を周囲温度で 5 時間撹拌した。水 (2 0 m L) を添加し、得られた混合物を酢酸エチル (2 × 1 0 m L) で抽出した。水層を 1 N 塩酸水溶液で酸性化し p H = 3 に調整した。次いで、水層をジクロロメタン (3 × 1 0 m L) 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砕し、オフホワイト色の固体 (2 . 1 g) を得た。M . P . = 1 5 2 ~ 1 5 5 。

【 0 2 8 2 】

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) (5 m L) 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 (E D C 、 0 . 5 8 g 、 1 . 1 m m o l) とペンタフルオロフェノール (0 . 4 9 g 、 1 . 1 m m o l) を周囲温度で添加し、得られた混合物を 3 時間撹拌した。別の丸底フラスコで、硫酸メチルヒドラジン (1 . 0 g 、 3 m m o l) をジクロロメタン (5 m L) に溶解させ、ジ - イソプロピルエチルアミン (0 . 9 3 g 、 3 m m o l) を添加し、得られた混合物を周囲温度で 1 5 分間撹拌した。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 E D C 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 3 0 分間撹拌した。水 (5 m L) を反応混合物に添加し、次いで、ジクロロメタン (3 × 5 m L) 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砕し、表題化合物を得、これをその後の工程で使用した (0 . 5 5 g 、 粗製) 。

【 0 2 8 3 】

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 (5 m L) 中粗混合物に、ピルビン酸エチル (0 . 4 1 g 、 1 . 5 m m o l) を周囲温度で添加し、得られた混合物を 1 6 時間撹拌した。反応混合物を減圧下で濃縮し、水 (5 m L) を添加した。混合物をジクロロメタン (3 × 5 m L) 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 1 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、淡褐色固体をジエチルエーテルとペンタンで粉砕した (0 . 2 g) 。M . S . = 3 3 3 (M + H) 。

【 0 2 8 4 】

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 (2 H) - ピリダジノン (化合物 2 9) 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 (2 m L) 溶液に、1 , 8 - ジアザビシクロ [5 . 4 . 0] ウンデカ - 7 - エン (0 . 4 5 g 、 5 . 0 m m o l) を 0 で添加した。得られた混合物を、周囲温度で 2 日間撹拌した。反応混合物を減圧下で濃縮し、水を添加し、続いて 2 N 塩酸水溶液を添加して p H = 3 に調整した。水層をジク

10

20

30

40

50

ロクロメタン (3 × 5 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 (0.1 g)。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) (550 mg、3.15 mmol) のテトラヒドロフラン (6 mL) 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 (7.0 mL、7.0 mmol、テトラヒドロフラン/トルエン中 1.0 M) 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 1.0 M、8.0 mL、8.0 mmol) 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 600 mg 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 (310 mg、1.22 mmol)、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) (69 mg、0.06 mmol) およびヨウ化銅 (I) (116 mg、0.61 mmol) 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) (485 mg、1.44 mmol) の 1, 4 - ジオキサン (3 mL) 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 (200 mg) 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) (200 mg、0.66 mmol) のモルホリン (1 mL) 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 2.0 N 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 (130 mg) 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】

10

20

30

40

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 ° で一晩撹拌した。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 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 - ブロモ - 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) をシリンジに取り、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ジ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 ° で一晩撹拌した。

【 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

星形撹拌子を備えた 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

例 5、工程 B の生成物、1.00 g、3.5 mmol に、モルホリン (3 mL) 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 (5 mL) 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 (1 N、10 mL) 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 0.89 g を得た。M.S. = 275 (AP+)。

【0292】

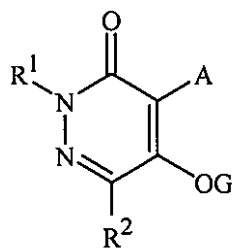
当技術分野で公知の方法と共に本明細書に記載の手順により、以下の表 1 ~ 271 の化合物を製造することができる。以下の表において、以下の略語が使用されている：t は第三級を意味し、i はイソを意味し、Me はメチルを意味し、Et はエチルを意味し、i-Pr はイソプロピルを意味し、Bu はブチルを意味し、c-Pr はシクロプロピルを意味し、OMe はメトキシを意味し、OEt はエトキシを意味し、-CN はシアノを意味する。以下の表に別段の指示がない限り、 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} のそれぞれは、CH である。

10

【0293】

【化 43】

表 1



20

R^1 は CH_3 であり、 R^2 は CH_3 であり、G は H であり、A は、以下の通りである。

【0294】

30

【表 8】

A-1(Y¹は、Sである)
 A-1(Y¹は、Sであり、X¹は、CCH₃である)
 A-1(Y¹は、Sであり、X¹は、CCH₃であり、
 X³は、CCIである)
 A-1(Y¹は、Sであり、X¹は、CCIである)
 A-1(Y¹は、Sであり、X³は、CCIである)
 A-1(Y¹は、Sであり、X³は、CBrである)
 A-1(Y¹は、Sであり、X³は、CFである)
 A-1(Y¹は、Sであり、X¹は、CCIであり、X³
 は、CCIである)
 A-1(Y¹は、Sであり、X¹は、CCH₃であり、
 X⁵は、CCIである)
 A-1(Y¹は、Sであり、X¹は、CCH₃であり、
 X⁵は、CCH₃である)
 A-1(Y¹は、Sであり、X³は、CCIであり、X⁵
 は、CCH₃である)
 A-1(Y¹は、Sであり、X¹は、CCH₃であり、
 X³は、CCIであり、X⁵は、CCH₃である)
 A-1(Y¹は、Oである)
 A-1(Y¹は、Oであり、X¹は、CCH₃である)
 A-1(Y¹は、Oであり、X¹は、CCH₃であり、
 X³は、CCIである)
 A-1(Y¹は、Oであり、X¹は、CCIである)
 A-1(Y¹は、Oであり、X³は、CCIである)
 A-1(Y¹は、Oであり、X³は、CBrである)
 A-1(Y¹は、Oであり、X³は、CFである)
 A-1(Y¹は、Oであり、X¹は、CIであり、X³
 は、CCIである)
 A-1(Y¹は、Oであり、X¹は、CCH₃であり、
 X⁵は、CCIである)
 A-1(Y¹は、Oであり、X¹は、CCH₃であり、
 X⁵は、CCH₃である)
 A-1(Y¹は、Oであり、X¹は、CCH₃であり、
 X³は、CCIであり、X⁵は、CCH₃である)
 A-1(Y¹は、Oであり、X³は、CCIであり、X⁵
 は、CCH₃である)

A-1(Y¹は、Oであり、X³は、CCIであり、X⁵
 は、CCIである)
 A-1(Y¹は、Sであり、X⁵は、Nである)
 A-1(Y¹は、Oであり、X⁵は、Nである)
 A-1(Y¹は、Sであり、X⁶は、Nである)
 A-1(Y¹は、Oであり、X⁶は、Nである)
 A-1(Y¹は、NCH₃である)
 A-1(Y¹は、NCH₃であり、X⁶は、Nである)
 A-1(Y¹は、Sであり、X¹は、Nである)
 A-1(Y¹は、Sであり、X²は、Nである)
 A-1(Y¹は、Sであり、X³は、Nである)
 A-1(Y¹は、Oであり、X¹は、Nである)
 A-1(Y¹は、Oであり、X²は、Nである)
 A-1(Y¹は、Oであり、X³は、Nである)
 A-1(Y¹は、NCH₃であり、X⁵は、Nである)
 A-1(Y¹は、NCH₃であり、X⁵は、Nであり、
 X⁶は、Nである)

A-2(Y²は、Sである)
 A-2(Y²は、Sであり、X¹は、CCIである)
 A-2(Y²は、Sであり、X¹は、CCH₃である)
 A-2(Y²は、Sであり、X³は、CCIである)
 A-2(Y²は、Sであり、X³は、CBrである)
 A-2(Y²は、Sであり、X³は、CFである)
 A-2(Y²は、Sであり、X¹は、CCH₃であり、
 X³は、CCIである)
 A-2(Y²は、Oである)
 A-2(Y²は、Oであり、X¹は、CCH₃である)
 A-2(Y²は、Oであり、X¹は、CCH₃であり、
 X³は、CCIである)
 A-2(Y²は、Oであり、X¹は、CCIである)
 A-2(Y²は、Oであり、X³は、CCIである)
 A-2(Y²は、Oであり、X³は、CBrである)
 A-2(Y²は、Oであり、X³は、CFである)
 A-2(Y²は、Oであり、X¹は、CCIであり、X³
 は、CCIである)

【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-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-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-2(Y^2 は、O であり、 X^3 は、 CCl であり、 X^5 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-2(Y^2 は、S であり、 X^3 は、N である)
 A-2(Y^2 は、O であり、 X^5 は、N である)
 A-2(Y^2 は、S であり、 X^4 は、N である)
 A-2(Y^2 は、O であり、 X^4 は、N である)
 A-2(Y^2 は、 NCH_3 である)
 A-2(Y^2 は、 NCH_3 であり、 X^4 は、N である)
 A-2(Y^2 は、S であり、 X^1 は、N である)
 A-2(Y^2 は、S であり、 X^2 は、N である)
 A-2(Y^2 は、S であり、 X^3 は、N である)
 A-2(Y^2 は、 NCH_3 であり、 X^4 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^1 は、N である)
 A-3(X^1 は、N であり、 X^3 は、 CCl である)
 A-3(X^1 は、N であり、 X^3 は、 $COMe$ である)
 A-3(X^1 は、N であり、 X^3 は、 CCH_3 である)
 A-3(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^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、 CCH_3 である)
 A-3(X^3 は、N である)*
 A-3(X^3 は、N であり、 X^1 は、 CCl である)
 A-3(X^3 は、N であり、 X^1 は、 $COMe$ である)
 A-3(X^3 は、N であり、 X^1 は、 CCH_3 である)
 A-3(X^3 は、N であり、 X^9 は、 CCl 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 である)*

A-3(X^7 は、N であり、 X^3 は、 CCl である)
 A-3(X^7 は、N であり、 X^3 は、 $COMe$ である)
 A-3(X^7 は、N であり、 X^3 は、 CCH_3 である)
 A-3(X^7 は、N であり、 X^1 は、 CCH_3 である)
 A-3(X^8 は、N である)*
 A-3(X^8 は、N であり、 X^3 は、 CCl である)
 A-3(X^8 は、N であり、 X^3 は、 $COMe$ である)
 A-3(X^8 は、N であり、 X^3 は、 CCH_3 である)
 A-3(X^8 は、N であり、 X^1 は、 CCH_3 である)
 A-3(X^9 は、N である)*
 A-3(X^9 は、N であり、 X^3 は、 CCl である)
 A-3(X^9 は、N であり、 X^3 は、 $COMe$ である)
 A-3(X^9 は、N であり、 X^3 は、 CCH_3 である)
 A-3(X^9 は、N であり、 X^1 は、 CCH_3 である)
 A-3(X^{10} は、N である)
 A-3(X^{10} は、N であり、 X^3 は、 CCl である)
 A-3(X^{10} は、N であり、 X^3 は、 $COMe$ である)
 A-3(X^{10} は、N であり、 X^3 は、 CCH_3 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、N である)
 A-3(X^1 は、N であり、 X^2 は、N 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^1 は、N であり、 X^2 は、N であり、 X^3 は、 CCH_3 である)
 A-3(X^2 は、N であり、 X^3 は、N である)
 A-3(X^8 は、N であり、 X^{10} は、N である)
 A-3(X^9 は、N であり、 X^{10} は、N である)
 A-3(X^7 は、N であり、 X^{10} は、N 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^7 は、N であり、 X^{10} は、N であり、 X^3 は、 CCH_3 である)
 A-3(X^7 は、N であり、 X^9 は、N 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 であり、 X^8 は、N である)
 A-3(X^1 は、N であり、 X^8 は、N であり、 X^3 は、 CCl である)

10

20

30

40

【表 10】

A-3(X¹ は、N であり、X⁸ は、N であり、X³ は、CCH₃ である)

A-3(X¹ は、N であり、X⁷ は、N である)

A-3(X¹ は、N であり、X⁸ は、N である)

A-3(X¹ は、N であり、X⁸ は、N である)

A-3(X¹ は、N であり、X¹⁰ は、N である)

A-3(X² は、N であり、X¹⁰ は、N である)

A-3(X² は、N であり、X⁹ は、N である)

A-3(X² は、N であり、X⁸ は、N である)

A-3(X² は、N であり、X⁸ は、N である)

A-3(X² は、N であり、X⁷ は、N である)

A-3(X³ は、N であり、X¹⁰ は、N である)

A-3(X³ は、N であり、X⁹ は、N である)

A-3(X³ は、N であり、X⁸ は、N である)

A-3(X³ は、N であり、X⁷ は、N である)

A-4(Y⁴ は、S であり、X¹⁰ は、N である)

A-4(Y⁴ は、S であり、X⁹ は、N である)

*表47、49、56および58には適用されない。

A-4(Y⁴ は、S であり、X⁸ は、N である)

A-4(Y⁴ は、S であり、X⁷ は、N である)

A-4(Y⁴ は、O であり、X¹⁰ は、N である)

A-4(Y⁴ は、O であり、X⁹ は、N である)

A-4(Y⁴ は、O であり、X⁸ は、N である)

A-4(Y⁴ は、O であり、X⁷ は、N である)

A-4(Y⁴ は、NCH₃ であり、X¹⁰ は、N である)

A-4(Y⁴ は、NCH₃ であり、X⁹ は、N である)

A-4(Y⁴ は、NCH₃ であり、X⁸ は、N である)

A-4(Y⁴ は、NCH₃ であり、X⁷ は、N である)

A-4(Y⁴ は、NCH₃ であり、X¹ は、N であり、X¹⁰ は、N である)

A-4(Y⁴ は、NCH₃ であり、X¹ は、N であり、X⁹ は、N である)

A-4(Y⁴ は、NCH₃ であり、X¹ は、N であり、X⁸ は、N である)

A-4(Y⁴ は、NCH₃ であり、X¹ は、N であり、X⁷ は、N である)

10

20

【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>i</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>i</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>i</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。	
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。	30
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>i</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>i</i> -Pr である。	

【0 2 9 9】

【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>i</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。
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。
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>i</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>i</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。
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。
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>i</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>i</i> -Pr である。

【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。	92	R ¹ は、Et であり、R ² は、Me であり、 G は、C(O)Me である。
75	R ¹ は、Me であり、R ² は、OMe であ り、G は、C(O)Et である。	93	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。	94	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。	95	R ¹ は、Et であり、R ² は、Me であり、 G は、C(O)-Ph 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。	96	R ¹ は、Et であり、R ² は、Me であり、 G は、CO ₂ Me 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。	97	R ¹ は、Et であり、R ² は、Me であり、 G は、CO ₂ Et 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。	98	R ¹ は、Et であり、R ² は、Me であり、 G は、CO ₂ -i-Pr 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。	99	R ¹ は、Et であり、R ² は、Me であり、 G は、CH ₂ OMe 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。	100	R ¹ は、Et であり、R ² は、Me であり、 G は、SO ₂ Me 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。	101	R ¹ は、Et であり、R ² は、H であり、 G は、C(O)Me である。
84	R ¹ は、Me であり、R ² は、OEt であり、 G は、C(O)Et 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。
85	R ¹ は、Me であり、R ² は、OEt であり、 G は、H である。	103	R ¹ は、Et であり、R ² は、H であり、 G は、H 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。	104	R ¹ は、Et であり、R ² は、H であり、 G は、C(O)-Ph 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。	105	R ¹ は、Et であり、R ² は、H であり、 G は、CO ₂ Me である。
88	R ¹ は、Me であり、R ² は、OEt であり、 G は、CO ₂ Et 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。
89	R ¹ は、Me であり、R ² は、OEt であり、 G は、CO ₂ -i-Pr 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。

【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。
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。
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 -i-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、CF ₃ であり、 G は、SO ₂ Me である。
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。
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。

【表 15】

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。
145	R ¹ は、Et であり、R ² は、Cl 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。
147	R ¹ は、Et であり、R ² は、Br 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。
149	R ¹ は、Et であり、R ² は、Br 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。
151	R ¹ は、Et であり、R ² は、Br 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。
153	R ¹ は、Et であり、R ² は、Br 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。
155	R ¹ は、Et であり、R ² は、I 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。
157	R ¹ は、Et であり、R ² は、I 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。
159	R ¹ は、Et であり、R ² は、I 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。
161	R ¹ は、Et であり、R ² は、I であり、G は、CO ₂ -i-Pr である。

表	表題行
162	R ¹ は、Et であり、R ² は、I であり、G は、CH ₂ OMe 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。
164	R ¹ は、Et であり、R ² は、OMe であり、 G は、C(O)Me 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。
166	R ¹ は、Et であり、R ² は、OMe であり、 G は、H 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。
168	R ¹ は、Et であり、R ² は、OMe であり、 G は、CO ₂ Me 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。
170	R ¹ は、Et であり、R ² は、OMe であり、 G は、CO ₂ -i-Pr 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。
172	R ¹ は、Et であり、R ² は、OMe であり、 G は、SO ₂ 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。
174	R ¹ は、Et であり、R ² は、OEt であり、 G は、C(O)Et である。
175	R ¹ は、Et であり、R ² は、OEt であり、 G は、H 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。
177	R ¹ は、Et であり、R ² は、OEt であり、 G は、CO ₂ Me 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。
179	R ¹ は、Et であり、R ² は、OEt であり、 G は、CO ₂ -i-Pr である。

10

20

30

40

【表 16】

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。 R ¹ は、Et であり、R ² は、OEt であり、 181 G は、SO ₂ Me である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Me であり、 182 G は、C(O)Me である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Me であり、 183 G は、C(O)Et である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Me であり、 184 G は、H である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Me であり、 185 G は、C(O)-Ph である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Me であり、 186 G は、CO ₂ Me である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Me であり、 187 G は、CO ₂ Et である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Me であり、 188 G は、CO ₂ -i-Pr である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Me であり、 189 G は、CH ₂ OMe である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Me であり、 190 G は、SO ₂ Me である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、H であり、 191 G は、C(O)Me である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、H であり、 192 G は、C(O)Et である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、H であり、 193 G は、H である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、H であり、 194 G は、C(O)-Ph である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、H であり、 195 G は、CO ₂ Me である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、H であり、 196 G は、CO ₂ Et である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、H であり、 197 G は、CO ₂ -i-Pr である。

表	表題行
198	R ¹ は、Pr であり、R ² は、H であり、 G は、CH ₂ OMe である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、H であり、 199 G は、SO ₂ Me である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Et であり、 200 G は、C(O)Me である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Et であり、 201 G は、C(O)Et である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Et であり、 202 G は、H である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Et であり、 203 G は、C(O)-Ph である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Et であり、 204 G は、CO ₂ Me である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Et であり、 205 G は、CO ₂ Et である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Et であり、 206 G は、CO ₂ -i-Pr である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Et であり、 207 G は、CH ₂ OMe である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Et であり、 208 G は、SO ₂ Me である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Pr であり、 209 G は、C(O)Me である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Pr であり、 210 G は、C(O)Et である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Pr であり、 211 G は、H である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Pr であり、 212 G は、C(O)-Ph である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Pr であり、 213 G は、CO ₂ Me である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Pr であり、 214 G は、CO ₂ Et である。 R ¹ は、Pr であり、R ² は、Pr であり、 215 G は、CO ₂ -i-Pr である。

10

20

30

40

【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。
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 Me である。
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 Et 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。
227	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Cl 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、Cl 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、Cl 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、Cl 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。
231	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Cl 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 Me である。
232	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Cl 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 Et である。
233	R ¹ は、Pr であり、R ² は、Cl 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。

【表 18】

表	表題行	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。	270	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OEt 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。	271	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OEt 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。	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
255	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OMe であり、G は、C(O)Et である。	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。	
256	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OMe であり、G は、H 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。	
257	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OMe 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。	
258	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OMe であり、G は、CO ₂ Me 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
259	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OMe であり、G は、CO ₂ Et である。	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。	
260	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OMe であり、G は、CO ₂ -i-Pr 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。	
261	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OMe であり、G は、CH ₂ OMe 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。	
262	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OMe であり、G は、SO ₂ Me 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。	30
263	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OEt であり、G は、C(O)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。	
264	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OEt であり、G は、C(O)Et である。	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。	
265	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OEt であり、G は、H 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。	
266	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OEt であり、G は、C(O)-Ph 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。	
267	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OEt であり、G は、CO ₂ Me である。	285	R ¹ は、 <i>c</i> -Pr であり、R ² は、Me であり、G は、C(O)Me である。	40
268	R ¹ は、Pr であり、R ² は、OEt であり、G は、CO ₂ Et である。	286	R ¹ は、 <i>c</i> -Pr であり、R ² は、Me であり、G は、C(O)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。	287	R ¹ は、 <i>c</i> -Pr であり、R ² は、Me であり、G は、CO ₂ Me である。	

【表 19】

表	表題行	表	表題行
288	R ¹ は、 <i>c</i> -Pr であり、R ² は、Me であり、 G は、H である。	287	R ¹ は、Me であり、R ² は、-CN であり、 G は、CO ₂ Me 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。	288	R ¹ は、Me であり、R ² は、-CN であり、 G は、H 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

【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、および土壌のタイプ、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、エマルジョン（マイクロエマルジョン、水中油型エマルジョン、フロアブル製剤および/またはサスポエマルジョン製剤を含む）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、濃縮エマルジョン、マイクロエマルジョン、水中油型エマルジョン、フロアブル製剤およびサスポエマルジョン製剤である。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。

20

【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、ブリル、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る。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。

30

【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るが、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可能である。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。

40

【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

10

【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、シクロヘキサノン、2-ヘプタノン、イソホロンおよび4-ヒドロキシ-4-メチル-2-ペンタノンのようなケトン、酢酸イソアミル、酢酸ヘキシル、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γ-ブチロラク톤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-ヘキサノール、2-エチルヘキサノール、n-オクタノール、デカノール、イソデシルアルコール、イソオクタデカノール、セチルアルコール、ラウリルアルコール、トリデシルアルコール、オレイルアルコール、シクロヘキサノール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ジアセトンアルコール、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

30

40

50

(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、湿潤剤、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化アルカノールアミド；エトキシ化されたダイズ油、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；エトキシ化脂肪酸；エトキシ化脂肪エステルおよび油；エトキシ化メチルエステル；エトキシ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、ポリエトキシ化ソルビタン脂肪酸エステル、ポリエトキシ化ソルビトール脂肪酸エステルおよびポリエトキシ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、グラフトまたはコム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：アルキルアリアルスルホン酸およびそれらの塩；カルボキシ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りグニン誘導体；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】

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、ならびにエトキシ化アミン、エトキシ化ジアミンおよびプロポキシ化アミン（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。

【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、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WO03/024222に列挙されるものが挙げられる。

【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砕することにより、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（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。乾燥製剤は、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、ブレンダーし、通常は磨砕（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

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DE 3,246,493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、GB 2,095,558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、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、2000を参照されたい。

20

30

【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

40

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%	10
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%	

【 0 3 2 6 】

【表 2 3】

実施例 C粒剤

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

【 0 3 2 7 】

【表 2 4】

実施例 D押出ペレット

化合物1	25.0%	30
無水硫酸ナトリウム	10.0%	
粗リグニンスルホン酸カルシウム	5.0%	
アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム	1.0%	
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マイクロエマルジョン

化合物1	5.0%	10
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%	

【 0 3 3 0 】

【表 2 7】

実施例 GSC 剤

化合物1	35%	20
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%	
キサントガム	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水中エマルジョン

化合物1	10.0%	40
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%	
キサントガム	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、土壌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、土壌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的な活性により、または、農作物と雑草の混合物の環境上または内の選択的な配置により、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・チューリンゲンシス（*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。

【0335】

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

【0336】

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0.001~20kg/haであり、約0.004~1kg/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。

【0337】

20

一般的な一実施形態において、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。

【0338】

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

【0339】

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(渇水、低温、土壌塩分など)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渇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

【0340】

以下の略語T1~T37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。

【0341】

【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	リシン増加	T32	HPPD 耐性
T7	昆虫抵抗性	T21	湯水耐性	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		

10

【 0 3 4 2 】

20

【表 3 1】

農作物	イベント名称	提示 C		形質	遺伝子	
		イベントコード				
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-00163-7	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)		
キャノーラ*	23-18-17 (イベント18)	CGN-89465-2	T2	te		
キャノーラ*	23-198 (イベント23)	CGN-89465-2	T2	te		
キャノーラ*	61061	DP-061061-7	T1	gat4621		
キャノーラ*	73496	DP-073496-4	T1	gat4621		10
キャノーラ*	GT200 (RT200)	MON-89249-2	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247		
キャノーラ*	GT73 (RT73)	MON-00073-7	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247		
キャノーラ*	HCN10 (Topas 19/2)	-	T3	bar		
キャノーラ*	HCN28 (T45)	ACS-BN008-2	T3	pat (syn)		
キャノーラ*	HCN92 (Topas 19/2)	ACS-BN007-1	T3	bar		
キャノーラ*	MON88302	MON-88302-9	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)		
キャノーラ*	MPS961	-	T4	phyA		
キャノーラ*	MPS962	-	T4	phyA		20
キャノーラ*	MPS963	-	T4	phyA		
キャノーラ*	MPS964	-	T4	phyA		
キャノーラ*	MPS965	-	T4	phyA		
キャノーラ*	MS1 (B91-4)	ACS-BN004-7	T3	bar		
キャノーラ*	MS8	ACS-BN005-8	T3	bar		
キャノーラ*	OXY-235	ACS-BN011-5	T5	bxn		
キャノーラ*	PHY14	-	T3	bar		
キャノーラ*	PHY23	-	T3	bar		
キャノーラ*	PHY35	-	T3	bar		
キャノーラ*	PHY36	-	T3	bar		30
キャノーラ*	RF1 (B93-101)	ACS-BN001-4	T3	bar		
キャノーラ*	RF2 (B94-2)	ACS-BN002-5	T3	bar		
キャノーラ*	RF3	ACS-BN003-6	T3	bar		
ピーン	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-01951A-7	T11	S4-HrA		
ワタ	281-24-236	DAS-24236-5	T3,T7	pat (syn); cry1F		
ワタ	3006-210-23	DAS-21023-5	T3,T7	pat (syn); cry1Ac		40
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		

【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	10
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	
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	20
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	
トウモロコシ	FI117	-	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	30
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	
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	40
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	
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	mocry1F; 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	10
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	X17-2	UFL-X17CP-6	T6	prsv cp	
プラム	C-5	ARS-PLMC5-6	T6	ppv cp	20
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	7Cp#242-95-7	-	T13	7crp	
イネ	7Cp#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)	30
イネ	GAT-OS2	-	T3	bar	
イネ	GAT-OS3	-	T3	bar	
イネ	PE-7	-	T7	Cry1Ac	
イネ	7Cp#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	40
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	

【表 3 5】

イネ	13pAprt1	-	T30	APRT	
イネ	gHvNAS1-gHvNAAT-1	-	T30	HvNAS1; HvNAAT-A; HvNAAT-B	
イネ	gHvIDS3-1	-	T30	HvIDS3	
イネ	gHvNAAT1	-	T30	HvNAAT-A; HvNAAT-B	
イネ	gHvNAS1-1	-	T30	HvNAS1	
イネ	NIA-OS006-4	-	T6	WRKY45	10
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	5AT; bp40 (f3'5'h)	20
バラ	WKS92 / 130-9-1	IFD-52901-9	T9	5AT; 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	csrl-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	30
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)	40
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 3 6】

ダイズ	W62	ACS-GM002-9	T3	bar	10
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	
カボチャ	CZW3	SEM-0CZW3-2	T6	cmv cp, zymv cp, wmv cp	
カボチャ	ZW20	SEM-0ZW20-7	T6	zymv cp, wmv cp	
サトウダイコン	GTSB77 (T9100152)	SY-GTSB77-8	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
サトウダイコン	H7-1	KM-000H71-4	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	20
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	
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(ブラシカ・ナプス(Brassica napus))、**ポーランド産(ブラシカ・ラパ(B.rapa))、
#ナス

【 0 3 4 8 】

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。

【 0 3 4 9 】

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(除草有効量で)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で)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は

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、交互に連続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ールおよびそのエステル（例えば、メチル、エチル）および塩（例えば、ナトリウム、カリウム）、アミノピラリド、アミトロール、スルファミン酸アンモニウム、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、ベントゾン、ベンゾピシクロン、ベンゾフェナップ、ピシクロピロン、ピフェノックス、ピラナホス、ビスピリバックおよびそのナトリウム塩、プロマシル、プロモブチド、プロモフェノキシム、プロモキシニル、オクタン酸プロモキシニル、ブタクロール、ブタフェナシル、ブタミホス、ブトラリン、ブトロキシジム、ブチレート、カフェンストロール、カルベタミド、カルフェントラゾン - エチル、カテキン、クロメトキシフェン、クロラムベン、クロルブロムロン、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、シンメシリン、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 - プロパルギル、クロマゾン、クロメブロップ、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、ダラボン、ダラボン - ナトリウム、ダゾメット、2, 4 - DB およびそのジメチルアンモニウム、カリウムおよびナトリウム塩、デスメディファム、デスメトリン、ジカンバおよびそのジグリコールアンモニウム、ジメチルアンモニウム、カリウムおよびナトリウム塩、ジクロベニル、ジクロルブロップ、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、ジメチピ

ン、ジメチルアルシン酸およびそのナトリウム塩、ジニトロアミン、ジノテルブ、ジフェナミド、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、フェノキサブロップ - エチル、フェノキサブロップ - 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、フラムブロップ - メチル、フラムブロップ - M - イソプロピル、フラムブロップ - 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、フルボキサム、フルビルスルフロン - メチルおよびそのナトリウム塩、フルレノール、フルレノール - ブチル、フルリドン、フルロクロリドン、フルロキシピル、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、グルホシネート、グルホシネート - アンモニウム、グルホシネート - 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
 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、イブフェンカルバゾン、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、メトスラム、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、ナプタラム、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、ペプレート、
 ペラルゴン酸、ペンジメタリン、ペノキススラム、ペンタノクロル、ペントキサゾン、ペ
 ルフルイドン、ペトキサミド、ペトキシアミド、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、プリ
 ミスルフロン - メチル、プロジアミン、プロホキシジム、プロメトン、プロメトリン、プロ
 パクロル、プロパニル、プロパキサホップ、プロパジン、プロファム、プロピソクロル
 、プロボキシカルバゾン、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
 、ピラゾリネート、ピラゾキシフェン、ピラゾスルフロン - エチル、ピリベンゾオキシム
 、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、テブラロキシジム、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、トブラメゾン、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、トリクロピ
 ル、トリクロピル - ブトチル、トリクロピル - トリエチルアンモニウム、トリジファン、
 トリエタジン、トリフロキシスルフロン、トリフルジモキサジン、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（以前はメチオキシリン）、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・デストルエンズ・シモンズ (*Alternaria destruens* Simmons)、コレトリカム・グロエオスポリオドズ (*Colletotrichum gloeosporioides*) (Penz .) Penz . & Sacc .、ドレシュイエラ・モノセラス (*Drechslera 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。

10

【 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、エボコレオン、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レ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。

20

【 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。

30

【 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 : 3000 と約 3000 : 1 の間である。注目すべきは、約 1 : 300 と約 300 : 1 の間の重量比 (例えば、約 1 : 30 と約 30 : 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。

40

【 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

50

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。

【 0 3 5 5 】

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。

【 0 3 5 6 】

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、シブロスルホンアミド、ダイムロン、ジクロロミド、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 - プロモ - 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。

【 0 3 5 7 】

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。

【 0 3 5 8 】

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

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

10

【0360】

【表 3 7】

表 A1

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	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	アスラム	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	ベフルプトアミド	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	ベントゾン	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	ベンゾビスクロン	1:85 - 14:1	1:28 - 5:1	1:10 - 1:2
1	ベンゾフェナプ	1:257 - 5:1	1:85 - 2:1	1:32 - 1:4
1	ビスクロピロン	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	ブロマシル	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

10

20

30

40

【表 3 8】

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	1:6-168:1	1:2-56:1	1:1-11:1
1	シンコスルフロ	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	クロランスラム-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	デスメジファム	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	ジクロスラム	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
1	ジフェンゾクアット	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	ジメタメトリン	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	ジメテンアミド-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

【表 3 9】

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	エタメトスルフロソ-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	エトキシスルフロソ	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	フェノキサプロップ-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	フラザスルフロソ	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	フロラスラム	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	フルセトスルフロソ	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
1	フルフェンアセト	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	フルピルスルフロソ-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	ホラムスルフロソ	1:13-84:1	1:4-28:1	1:1-6:1
1	グルホシネート	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	ハロスルフロソ-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

【 0 3 6 3 】

【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-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	イマゾスルフロソ	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	ヨードスルフロソ-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	イブフェンカルバゾン	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	メソスルフロソ-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	メタソスルフロソ	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	メトスルフロソ-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

【表 4 1】

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	ナブタラム	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	ペノキススラム	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	プロバクロル	1:1152 - 1:1	1:384 - 1:3	1:144 - 1:16
1	プロバニル	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	プロボキシカルバゾン	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

【表 4 2】

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	ピラズスルフロニ-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	ピロキシスラム	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	リムスルフロニ	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	スルホスルフロニ	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 4 3】

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	チフェンスルフロソ-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	トラルコキシジム	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	トリアスルフロソ	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	トリクロピル	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
1	トリフロキシスルフロソ	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	トリフルスルフロソ-メチル	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
1	トリトスルフロソ	1:13-84:1	1:4-28:1	1:1-6:1

10

20

【0367】

表 A 2 は、「成分 (a)」欄見出しの下項目が、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 A 1 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 A 2 において、「成分 (a)」欄見出しの下項目は全て「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 A 2 における欄見出しの下第 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 A 3 ~ A 7 も同様に構成されている。

30

【0368】

【表 4 4】

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	10
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	20
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	30
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	40
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】

望ましくない植生により良好な防除（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、ピロキシスラム、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。

【 0 3 7 0 】

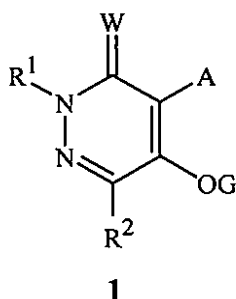
以下の試験は、特定の雑草に対する本発明の化合物の防除効能を実証する。しかしながら、これらの化合物によって得られる雑草防除はこれらの種に限定されない。化合物の説明については索引表 A を参照されたい。以下の索引表において、以下の略語が使用されている： c - P r はシクロプロピルであり、「 C m p d . N o . 」は「化合物番号」を表し、「 E x . 」は「実施例」を表し、どの実施例においてその化合物が製造されているかを示す数字が続いている。別段の指示がない限り、以下の索引表において、 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} 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、 $CDCl_3$ 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、 $\pm 0.5 Da$ の推定精度で報告される。

【 0 3 7 1 】

【 化 4 4 】

索引表 A



【 0 3 7 2 】

【表 4 5】

化合物 番号	(R ¹)	R ²	W	A	G	(°C)または AP+	
1	CH ₃	CH ₃	O	A-1(Y ¹ は、Sであり、X ⁶ は、N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-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	10
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)	C(O)OCH ₂ CH ₃	165-169	
6	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)O- <i>i</i> -Pr	145-148	
7	CH ₃	CH ₃	O	A-2(Y ² は、Oであり、X ¹ は、CCH ₃ である)	H	244-247	
8	CH ₃	CH ₃	O	A-3(X ² は、Nである)	C(O)CH ₃	310 (AP ⁺)	20
9	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)- <i>c</i> -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	30

【 0 3 7 3 】

【表 4 6】

化合物 番号	(R ¹)	R ²	W	A	G	(°C)または 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>i</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>i</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)- <i>c</i> -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)- <i>c</i> -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

10

20

30

40

【表 4 7】

化合物 番号	(R ¹)	R ²	W	A	G	(°C)または 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	10
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	20
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	30
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	40
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	*	

【表 4 8】

化合物 番号	(R ¹)	R ²	W	A	G	(°C)または AP+	
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 4 9】

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).
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).

10

【 0 3 7 7 】

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 (*Echinochloa crus-galli*))、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*、ロリウム・マルチフロラム (*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・レトロフレックス (*Amaranthus retroflexus*))から選択される植物種の種子をローム土壌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壌噴霧で発生前処理した。

30

【 0 3 7 8 】

同時に、これらの雑草種、ならびに、コムギ(トリチウム・アエスチブム (*Triticum aestivum*))、コーン(ゼア・マイズ (*Zea mays*))、ブラックグラス(アロペクルス・ミオスロイデス (*Alopecurus myosuroides*))およびヤエムグラ(*catchweed bedstraw*、ガリウム・アパリネ (*Galium aparine*))から選択される植物を同一のローム土壌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 ~ 10 cm 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

【 0 3 7 9 】

【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	ハウキギ	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	
ハウキギ	0	コムギ	0	

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	
ハウキギ	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															
500 g ai/ha	15	16	18	19	20	21	23	24	25	27	29	30	31	32	52	
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	
ハウキギ	0	100	0	0	0	0	0	0	100	0	100	100	100	70	20	40
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	

【 0 3 8 0 】

【表 5 1】

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
ハウキギ	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													
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
ハウキギ	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														
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
ハウキギ	90	90	90	20	100	0	30	10	0	0	0	0	0	0

【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
ハウキギ	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

20

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

30

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
ハウキギ	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

40

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	0	10	20	10	0
------	----	----	---	---	---	---	---	---	---	---	---	----	----	----	---

【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

10

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

20

30

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

40

【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				表 A	化合物									
1000 g ai/ha	35				500 g ai/ha	52									
発生前					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	20
ホウキギ	0	60	20	60	30	50	90	0	30	100	100	100	100	0	
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	40	0	90	90	90	40	30
アキノエノコログサ	0	0	0	0	0	0	0	0	80	50	90	80	90	50	
ホウキギ	0	100	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	
ブタクサ	0	70	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	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															40
イヌビエ	0	0	0	0	0	0	10	0	0	80	50	0	20	0	
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	

【 0 3 8 5】

【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
------------	---	----	----	---	---	---	---	----	---	----	---	----	----	----

10

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
------------	----	----	----	----	-----	---	----	---	---	----	----	-----	----	----

20

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
------------	----	----	-----	----	----	----	----	-----	----	----	----	-----	----	----

30

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	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	-	-	-	-	-	-	-
--------	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---	---

40

【 0 3 8 6 】

【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															10
イヌビエ		0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	10	10	
アキノエノコログサ		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	
アカザ		30	100	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	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

10

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															20
イヌビエ		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	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	50	0	
アカザ		0	0	100	60	20	30	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	
イタリアンライグラス		0	0	90	0	10	20	60	60	0	30	80	10	0	0

20

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

30

40

【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

rus difformis))、アメリカコナギ(ヘテランテラ・リモサ(Heteranthera limosa))、およびイヌビエ(エチノクロア・クルス-ガルリ(Echinochloa crus-galli))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、試験ポットを土壌表面より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】

表 B	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	0
														10
表 B	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
														20
表 B	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
														30
表 B	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
														40
表 B	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	
<i>C 0 7 D 403/04 (2006.01)</i>		C 0 7 D 403/04	
<i>A 0 1 P 13/00 (2006.01)</i>		A 0 1 P 13/00	
<i>A 0 1 N 43/90 (2006.01)</i>		A 0 1 N 43/90	1 0 2
<i>A 0 1 N 43/58 (2006.01)</i>		A 0 1 N 43/58	B
<i>A 0 1 N 43/80 (2006.01)</i>		A 0 1 N 43/80	1 0 2
<i>A 0 1 N 43/78 (2006.01)</i>		A 0 1 N 43/78	1 0 1
<i>A 0 1 N 47/06 (2006.01)</i>		A 0 1 N 47/06	D
<i>A 0 1 N 43/647 (2006.01)</i>		A 0 1 N 43/647	

(72)発明者 トーマス・ポール・セルビー
アメリカ合衆国デラウェア州 1 9 7 0 7 . ホッケシン . ベンジ・ロード 8 2 0

(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 1 9 0 6 3 . メディア . ローカストレーン 1 2 2

審査官 早乙女 智美

(56)参考文献 特開 2 0 1 3 - 0 2 8 5 8 2 (J P , A)
国際公開第 2 0 1 4 / 0 3 1 9 7 1 (WO , A 1)
特表 2 0 1 5 - 5 1 7 9 9 7 (J P , A)
国際公開第 2 0 1 1 / 0 4 5 2 7 1 (WO , A 1)
特表 2 0 1 1 - 5 0 7 8 9 3 (J P , A)
BABICHEV, F. S. et al., 6-Amino-1-aryl-4-pyridazinones and their derivatives, Ukrainskii Khimicheskii Zhurnal (Russian Edition) , 1 9 8 3 年, 49(11) , pp. 1197-1202

(58)調査した分野(Int.Cl. , D B 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)