

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第5847921号
(P5847921)

(45) 発行日 平成28年1月27日(2016.1.27)

(24) 登録日 平成27年12月4日(2015.12.4)

(51) Int.Cl.

F 1

AO1N 43/653	(2006.01)	AO1N 43/653	N
AO1N 43/713	(2006.01)	AO1N 43/713	
AO1P 13/00	(2006.01)	AO1P 13/00	
AO1N 41/10	(2006.01)	AO1N 41/10	A
AO1N 43/08	(2006.01)	AO1N 43/08	G

請求項の数 7 (全 137 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2014-500369 (P2014-500369)
(86) (22) 出願日	平成24年3月21日 (2012.3.21)
(65) 公表番号	特表2014-510089 (P2014-510089A)
(43) 公表日	平成26年4月24日 (2014.4.24)
(86) 國際出願番号	PCT/EP2012/054981
(87) 國際公開番号	W02012/130685
(87) 國際公開日	平成24年10月4日 (2012.10.4)
審査請求日	平成27年3月17日 (2015.3.17)
(31) 優先権主張番号	11159755.5
(32) 優先日	平成23年3月25日 (2011.3.25)
(33) 優先権主張国	欧洲特許庁 (EP)
(31) 優先権主張番号	61/467,619
(32) 優先日	平成23年3月25日 (2011.3.25)
(33) 優先権主張国	米国 (US)

(73) 特許権者	512137348 バイエル・インテレクチュアル・プロパティ・ゲゼルシャフト・ミット・ベシェレンクテル・ハフツング Bayer Intellectual Property GmbH ドイツ40789モンハイム・アム・ライン、アルフレート-ノーベル-シュトラーセ10番
(74) 代理人	100146318 弁理士 岩瀬 吉和
(74) 代理人	100114188 弁理士 小野 誠
(74) 代理人	100119253 弁理士 金山 賢教

最終頁に続く

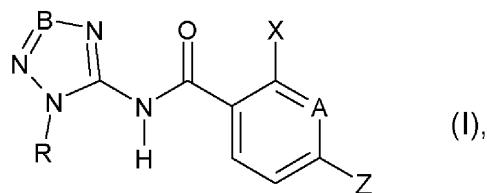
(54) 【発明の名称】 HPPD阻害薬型除草剤に対して耐性であるトランスジェニック作物の区域で望ましくない植物を防除するためのN- (テトラゾール-4-イル) - もしくはN- (トリアゾール-3-イル)

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

(I) (a) カラスムギ属、(b) シュードモナス (*Pseudomonas*)、(c) シネココッコイデアエ (*Synechococcoideae*)、(d) アミカ (*Blepharismaidae*)、(e) ロドコッカス (*Rhodococcus*)、(f) ピクロフィルス科 (*Picrophilaceae*)、(g) コルディア (*Kordia*) からなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ (HPPD) をコードするDNA配列を含み、または(I)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列を含む1以上のキメラ遺伝子を含むことでHPPD阻害薬型除草剤に対して耐性であるトランスジェニック作物の区域において望ましくない植物を防除するための下記式(I)のN- (テトラゾール-4-イル) - もしくはN- (トリアゾール-3-イル) アリールカルボキサミド類もしくは該化合物の塩の使用。

【化1】



10

[式中、

Aは、NもしくはCYであり、

Bは、NもしくはCHであり、

Xは、ニトロ、ハロゲン、シアノ、ホルミル、チオシアナト、(C₁-C₆) - アルキル、ハロ - (C₁-C₆) - アルキル、(C₂-C₆) - アルケニル、ハロ - (C₂-C₆) - アルケニル、(C₂-C₆) - アルキニル、ハロ - (C₃-C₆) - アルキニル、(C₃-C₆) - シクロアルキル、ハロ - (C₃-C₆) - シクロアルキル、(C₃-C₆) - シクロアルキル - (C₁-C₆) - アルキル、ハロ - (C₃-C₆) - シクロアルキル - (C₁-C₆) - アルキル、COR¹、COOR¹、OCOOR¹、NR¹COO R¹、C(O)N(R¹)₂、NR¹C(O)N(R¹)₂、OC(O)N(R¹)₂、C(O)NR¹OR¹、OR¹、OCOR¹、OSO₂R²、S(O)_nR²、SO₂O R¹、SO₂N(R¹)₂、NR¹SO₂R²、NR¹COR¹、(C₁-C₆) - アルキル - S(O)_nR²、(C₁-C₆) - アルキル - OR¹、(C₁-C₆) - アルキル - OCOR¹、(C₁-C₆) - アルキル - OSO₂R²、(C₁-C₆) - アルキル - CO₂R¹、(C₁-C₆) - アルキル - SO₂OR¹、(C₁-C₆) - アルキル - CON(R¹)₂、(C₁-C₆) - アルキル - NR¹COOR¹、(C₁-C₆) - アルキル - NR¹SO₂R²、NR₁R₂、P(O)(OR⁵)₂、CH₂P(O)(OR⁵)₂、(C₁-C₆) - アルキル - ヘテロアリール、(C₁-C₆) - アルキル - 複素環であり、最後に挙げた2個の基は各場合でs個のハロゲン、(C₁-C₆) - アルキル、ハロ - (C₁-C₆) - アルキル、S(O)_n - (C₁-C₆) - アルキル、(C₁-C₆) - アルコキシおよび/またはハロ - (C₁-C₆) - アルコキシ基によって置換されており、複素環は0から2個のオキソ基を有し、

Yは、水素、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、(C₁-C₆) - アルキル、ハロ - (C₁-C₆) - アルキル、(C₂-C₆) - アルケニル、ハロ - (C₂-C₆) - アルケニル、(C₂-C₆) - アルキニル、ハロ - (C₂-C₆) - アルキニル、(C₃-C₆) - シクロアルキル、(C₃-C₆) - シクロアルケニル、ハロ - (C₃-C₆) - シクロアルキル、(C₃-C₆) - シクロアルキル - (C₁-C₆) - アルキル、ハロ - (C₃-C₆) - シクロアルキル - (C₁-C₆) - アルキル、COR¹、COOR¹、OCOOR¹、NR¹COOR¹、C(O)N(R¹)₂、NR¹C(O)N(R¹)₂、OC(O)N(R¹)₂、CO(NOR¹)R¹、NR¹SO₂R²、NR¹CO R¹、OR¹、OSO₂R²、S(O)_nR²、SO₂OR¹、SO₂N(R¹)₂、(C₁-C₆) - アルキル - S(O)_nR²、(C₁-C₆) - アルキル - OR¹、(C₁-C₆) - アルキル - OCOR¹、(C₁-C₆) - アルキル - OSO₂R²、(C₁-C₆) - アルキル - CO₂R¹、(C₁-C₆) - アルキル - CN、(C₁-C₆) - アルキル - SO₂OR¹、(C₁-C₆) - アルキル - CON(R¹)₂、(C₁-C₆) - アルキル - SO₂N(R¹)₂、(C₁-C₆) - アルキル - NR¹COOR¹、(C₁-C₆) - アルキル - NR¹SO₂R²、N(R¹)₂、P(O)(OR⁵)₂、CH₂P(O)(OR⁵)₂、(C₁-C₆) - アルキル - ヘテロアリール、(C₁-C₆) - アルキル - 複素環、フェニル、(C₁-C₆) - アルキル - ヘテロアリールもし

50

くは複素環であり、最後の 6 個の基は各場合でハロゲン、ニトロ、シアノ、(C₁ - C₆) - アルキル、ハロ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、S (O)_n - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシ、ハロ - (C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₄) - アルキルおよびシアノメチルからなる群からの s 個の基によって置換されており、複素環は 0 から 2 個のオキソ基を有しており、

Z は、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、ハロ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、ハロ - (C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、ハロ - (C₂ - C₆) - アルキニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル - (C₁ - C₆) - アルキル、ハロ - (C₃ - C₆) - シクロアルキル - (C₁ - C₆) - アルキル、COR¹、COOR¹、OCOOR¹、NR¹COOR¹、C(O)N(R¹)₂、NR¹C(O)N(R¹)₂、OC(O)N(R¹)₂、C(O)NR¹OR¹、OSO₂R²、S(O)nR²、SO₂OR¹、SO₂N(R¹)₂、NR¹SO₂R²、NR¹COR¹、(C₁ - C₆) - アルキル - S(O)nR²、(C₁ - C₆) - アルキル - OR¹、(C₁ - C₆) - アルキル - OCOR¹、(C₁ - C₆) - アルキル - OSO₂R²、(C₁ - C₆) - アルキル - CO₂R¹、(C₁ - C₆) - アルキル - SO₂OR¹、(C₁ - C₆) - アルキル - CON(R¹)₂、(C₁ - C₆) - アルキル - SO₂N(R¹)₂、(C₁ - C₆) - アルキル - NR¹COR¹、(C₁ - C₆) - アルキル - NR¹SO₂R²、N(R¹)₂、P(O)(OR⁵)₂、ヘテロアリール、複素環もしくはフェニルであり、最後の 3 個の基は各場合でハロゲン、ニトロ、シアノ、(C₁ - C₆) - アルキル、ハロ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、S(O)_n - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシもしくはハロ - (C₁ - C₆) - アルコキシからなる群からの s 個の基によって置換されており、複素環は 0 から 2 個のオキソ基を有しており、または

Y が基 S(O)_nR² である場合には、Z は水素、(C₁ - C₆) - アルキルもしくは(C₁ - C₆) - アルコキシであっても良く、

R は、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₇) - シクロアルキル、ハロ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、ハロ - (C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、ハロ - (C₂ - C₆) - アルキニル、CH₂R⁶、ヘテロアリール、複素環もしくはフェニルであり、最後の 3 個の基は各場合でハロゲン、ニトロ、シアノ、(C₁ - C₆) - アルキル、ハロ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、S(O)_n - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシ、ハロ - (C₁ - C₆) - アルコキシおよび(C₁ - C₆) - アルコキシ - (C₁ - C₄) - アルキルからなる群からの s 個の基によって置換されており、

R¹ は、水素、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₆) - ハロアルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、(C₂ - C₆) - ハロアルキニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルケニル、(C₃ - C₆) - ハロシクロアルキル、(C₁ - C₆) - アルキル - O - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル - (C₁ - C₆) - アルキル、フェニル、フェニル - (C₁ - C₆) - アルキル、ヘテロアリール、(C₁ - C₆) - アルキル - ヘテロアリール、複素環、(C₁ - C₆) - アルキル - 複素環、(C₁ - C₆) - アルキル - O - ヘテロアリール、(C₁ - C₆) - アルキル - O - 複素環、(C₁ - C₆) - アルキル - NR³ - ヘテロアリール、(C₁ - C₆) - アルキル - NR³ - 複素環であり、最後に挙げた 21 個の基はシアノ、ハロゲン、ニトロ、チオシアナト、OR³、S(O)_nR⁴、N(R³)₂、NR³OR³、COR³、OCOR³、SCO R⁴、NR³COR³、NR³SO₂R⁴、CO₂R³、COSR⁴、CON(R³)₂ および(C₁ - C₄) - アルコキシ - (C₂ - C₆) - アルコキシカルボニルからなる群からの s 個の基によって置換されており、複素環は 0 から 2 個のオキソ基を有しており、

R² は、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - ハロアルキル、(C₂ - C₆)) 50

- アルケニル、(C₂ - C₆) - ハロアルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、(C₂ - C₆) - ハロアルキニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルケニル、(C₃ - C₆) - ハロシクロアルキル、(C₁ - C₆) - アルキル-O-(C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル - (C₁ - C₆) - アルキル、フェニル、フェニル - (C₁ - C₆) - アルキル、ヘテロアリール、(C₁ - C₆) - アルキル - ヘテロアリール、複素環、(C₁ - C₆) - アルキル - 複素環、(C₁ - C₆) - アルキル - O - ヘテロアリール、(C₁ - C₆) - アルキル - O - 複素環、(C₁ - C₆) - アルキル - NR³ - ヘテロアリール、(C₁ - C₆) - アルキル - NR³ - 複素環であり、最後に挙げた21個の基はシアノ、ハロゲン、ニトロ、チオシアナト、OR³、S(O)_nR⁴、N(R³)₂、NR³OR³、COR³、OCOR³、SCOR⁴、NR³COR³、NR³SO₂R⁴、CO₂R³、COSR⁴、CON(R³)₂および(C₁ - C₄) - アルコキシ - (C₂ - C₆) - アルコキカルボニルからなる群からのs個の基によって置換されており、複素環は0から2個のオキソ基を有しております。 10

R³は、水素、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキルもしくは(C₃ - C₆) - シクロアルキル - (C₁ - C₆) - アルキルであり。

R⁴は、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニルもしくは(C₂ - C₆) - アルキニルであり、

R⁵は、メチルもしくはエチルであり、

R⁶は、アセトキシ、アセトアミド、N-メチルアセトアミド、ベンゾイルオキシ、ベンズアミド、N-メチルベンズアミド、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ベンゾイル、メチルカルボニル、ピペリジニルカルボニル、モルホリニルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) - アルコキシもしくは(C₃ - C₆) - シクロアルキルであり、または各場合でメチル、エチル、メトキシ、トリフルオロメチルおよびハロゲンからなる群からのs個の基によって置換されているヘテロアリール、複素環もしくはフェニルであり。 20

nは0、1もしくは2であり、

sは0、1、2もしくは3である。]

【請求項2】

式(I)において、

AがNもしくはCYであり、

BがNもしくはCHであり、

Xが、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、(C₁ - C₆) - アルキル、ハロ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、ハロ - (C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、ハロ - (C₃ - C₆) - アルキニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、ハロ - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₆) - アルキル - O - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル - (C₁ - C₆) - アルキル、ハロ - (C₃ - C₆) - シクロアルキル - (C₁ - C₆) - アルキル、COR¹、OR¹、OCOR¹、OSO₂R²、S(O)_nR²、SO₂OR¹、SO₂N(R¹)₂、NR¹SO₂R²、NR¹COR¹、(C₁ - C₆) - アルキル - S(O)nR²、(C₁ - C₆) - アルキル - OR¹、(C₁ - C₆) - アルキル - OCOR¹、(C₁ - C₆) - アルキル - OSO₂R²、(C₁ - C₆) - アルキル - CO₂R¹、(C₁ - C₆) - アルキル - SO₂OR¹、(C₁ - C₆) - アルキル - CON(R¹)₂、(C₁ - C₆) - アルキル - SO₂N(R¹)₂、(C₁ - C₆) - アルキル - NR¹SO₂R²、(C₁ - C₆) - アルキル - ヘテロアリール、(C₁ - C₆) - アルキル - 複素環であり、最後に挙げた2個の基が各場合でs個のハロゲン、(C₁ - C₆) - アルキル、ハロ - (C₁ - C₆) - アルキル、S(O)_n - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシおよび/またはハロ - (C₁ - C₆) - アルコキシ基によって置換されており、複素環が0から2個 40

基によって置換されており、複素環が0から2個 50

のオキソ基を有しており、

Yが、水素、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、(C₁-C₆) - アルキル、ハロ - (C₁-C₆) - アルキル、(C₂-C₆) - アルケニル、ハロ - (C₂-C₆) - アルケニル、(C₂-C₆) - アルキニル、ハロ - (C₃-C₆) - アルキニル、(C₃-C₆) - シクロアルキル、(C₃-C₆) - シクロアルケニル、ハロ - (C₃-C₆) - シクロアルキル、(C₃-C₆) - シクロアルキル - (C₁-C₆) - アルキル、ハロ - (C₃-C₆) - シクロアルキル - (C₁-C₆) - アルキル、COR¹、OR¹、COOR¹、OSO₂R²、S(O)_nR²、SO₂OR¹、SO₂N(R¹)₂、N(R¹)₂、NR¹SO₂R²、NR¹COR¹、(C₁-C₆) - アルキル - S(O)_nR²、(C₁-C₆) - アルキル - OR¹、(C₁-C₆) - アルキル - OCOR¹、(C₁-C₆) - アルキル - OSO₂R²、(C₁-C₆) - アルキル - CO₂R¹、(C₁-C₆) - アルキル - SO₂OR¹、(C₁-C₆) - アルキル - CON(R¹)₂、(C₁-C₆) - アルキル - SO₂N(R¹)₂、(C₁-C₆) - アルキル - NR¹COR¹、(C₁-C₆) - アルキル - NR¹SO₂R²、(C₁-C₆) - アルキル - フエニル、(C₁-C₆) - アルキル - ヘテロアリール、(C₁-C₆) - アルキル - 複素環、フェニル、ヘテロアリールもしくは複素環であり、最後の6個の基が各場合でハロゲン、ニトロ、シアノ、(C₁-C₆) - アルキル、ハロ - (C₁-C₆) - アルキル、(C₃-C₆) - シクロアルキル、S(O)_n - (C₁-C₆) - アルキル、(C₁-C₆) - アルコキシ、ハロ - (C₁-C₆) - アルコキシ、(C₁-C₆) - アルコキシ - (C₁-C₄) - アルキルおよびシアノメチルからなる群からのs個の基によって置換されており、複素環が0から2個のオキソ基を有しております、

Zが、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、ハロ - (C₁-C₆) - アルキル、(C₂-C₆) - アルケニル、ハロ - (C₂-C₆) - アルケニル、(C₂-C₆) - アルキニル、ハロ - (C₃-C₆) - アルキニル、(C₃-C₆) - シクロアルキル、ハロ - (C₃-C₆) - シクロアルキル、(C₃-C₆) - シクロアルキル - (C₁-C₆) - アルキル、ハロ - (C₃-C₆) - シクロアルキル - (C₁-C₆) - アルキル、COR¹、COOR¹、C(O)N(R¹)₂、C(O)NR¹OR¹、OSO₂R²、S(O)_nR²、SO₂OR¹、SO₂N(R¹)₂、NR¹SO₂R²、NR¹COR¹、(C₁-C₆) - アルキル - S(O)_nR²、(C₁-C₆) - アルキル - OR¹、(C₁-C₆) - アルキル - OCOR¹、(C₁-C₆) - アルキル - OSO₂R²、(C₁-C₆) - アルキル - CO₂R¹、(C₁-C₆) - アルキル - SO₂OR¹、(C₁-C₆) - アルキル - CON(R¹)₂、(C₁-C₆) - アルキル - SO₂N(R¹)₂、(C₁-C₆) - アルキル - NR¹COR¹、(C₁-C₆) - アルキル - NR¹SO₂R²もしくは1,2,4-トリアゾール-1-イルであり、または

Yが基S(O)_nR²である場合に、Zが水素、(C₁-C₆) - アルキルもしくは(C₁-C₆) - アルコキシであっても良く、

Rが、(C₁-C₆) - アルキル、(C₃-C₇) - シクロアルキル、ハロ - (C₁-C₆) - アルキル、(C₃-C₇) - シクロアルキルメチル、メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチル、アセチルメチル、メトキシメチルまたはフェニルもしくはベンジルであり、それらはそれぞれメチル、メトキシ、トリフルオロメチルおよびハロゲンからなる群からのs個の基によって置換されており、

R¹が、水素、(C₁-C₆) - アルキル、(C₂-C₆) - アルケニル、(C₂-C₆) - アルキニル、(C₃-C₆) - シクロアルキル、(C₃-C₆) - シクロアルキル - (C₁-C₆) - アルキル、(C₁-C₆) - アルキル - O - (C₁-C₆) - アルキル、フェニル、フェニル - (C₁-C₆) - アルキル、ヘテロアリール、(C₁-C₆) - アルキル - ヘテロアリール、複素環、(C₁-C₆) - アルキル - O - ヘテロアリール、(C₁-C₆) - アルキル - O - 複素環、(C₁-C₆) - アルキル - NR³ - ヘテロアリールもしくは(C₁-C₆) - アルキル - NR³ - 複素環であり、最後に挙げた16個の基がシアノ、ハロゲン、ニトロ、OR³、S(O)_nR⁴、N(R³)₂、NR³OR³、COR³、OCOR³、NR³COR³、N 50

$R^3SO_2R^4$ 、 CO_2R^3 、 $CON(R^3)_2$ および(C_1-C_4) - アルコキシ - (C_2-C_6) - アルコキシカルボニルからなる群からのs個の基によって置換されており、複素環が0から2個のオキソ基を有しており、

R^2 が、(C_1-C_6) - アルキル、(C_2-C_6) - アルケニル、(C_2-C_6) - アルキニル、(C_3-C_6) - シクロアルキル、(C_3-C_6) - シクロアルキル - (C_1-C_6) - アルキル、(C_1-C_6) - アルキル - O - (C_1-C_6) - アルキル、フェニル、フェニル - (C_1-C_6) - アルキル、ヘテロアリール、(C_1-C_6) - アルキル - ヘテロアリール、複素環、(C_1-C_6) - アルキル - 複素環、(C_1-C_6) - アルキル - O - ヘテロアリール、(C_1-C_6) - アルキル - O - 複素環、(C_1-C_6) - アルキル - NR³ - ヘテロアリールもしくは(C_1-C_6) - アルキル - NR³ - 複素環であり、これらの基がシアノ、ハロゲン、ニトロ、OR³、S(O)_nR⁴、N(R³)₂、NR³OR³、NR³SO₂R⁴、COR³、OCOR³、NR³COR³、CO₂R³、CON(R³)₂および(C_1-C_4) - アルコキシ - (C_2-C_6) - アルコキシカルボニルからなる群からのs個の基によって置換されており、複素環が0から2個のオキソ基を有しており、

R^3 が、水素、(C_1-C_6) - アルキル、(C_2-C_6) - アルケニル、(C_2-C_6) - アルキニル、(C_3-C_6) - シクロアルキルもしくは(C_3-C_6) - シクロアルキル - (C_1-C_6) - アルキルであり、

R^4 が、(C_1-C_6) - アルキル、(C_2-C_6) - アルケニルもしくは(C_2-C_6) - アルキニルであり、

nが0、1もしくは2であり、

sが0、1、2もしくは3である請求項1に記載の使用。

【請求項3】

式(I)において、

AがNもしくはCYであり、

BがNもしくはCHであり、

Xが、ニトロ、ハロゲン、シアノ、(C_1-C_6) - アルキル、ハロ - (C_1-C_6) - アルキル、(C_3-C_6) - シクロアルキル、OR¹、S(O)_nR²、(C_1-C_6) - アルキル - S(O)_nR²、(C_1-C_6) - アルキル - OR¹、(C_1-C_6) - アルキル - CON(R¹)₂、(C_1-C_6) - アルキル - SO₂N(R¹)₂、(C_1-C_6) - アルキル - NR¹COR¹、(C_1-C_6) - アルキル - NR¹SO₂R²、(C_1-C_6) - アルキル - ヘテロアリールもしくは(C_1-C_6) - アルキル - 複素環であり、最後に挙げた2個の基が各場合でs個のハロゲン、(C_1-C_6) - アルキル、ハロ - (C_1-C_6) - アルキル、S(O)_n - (C_1-C_6) - アルキル、(C_1-C_6) - アルコキシおよび/またはハロ - (C_1-C_6) - アルコキシ基によって置換されており、複素環が0から2個のオキソ基を有しており、

Yが、水素、ニトロ、ハロゲン、シアノ、(C_1-C_6) - アルキル、(C_1-C_6) - ハロアルキル、OR¹、S(O)_nR²、SO₂N(R¹)₂、N(R¹)₂、NR¹SO₂R²、NR¹COR¹、(C_1-C_6) - アルキル - S(O)_nR²、(C_1-C_6) - アルキル - OR¹、(C_1-C_6) - アルキル - CON(R¹)₂、(C_1-C_6) - アルキル - SO₂N(R¹)₂、(C_1-C_6) - アルキル - NR¹COR¹、(C_1-C_6) - アルキル - NR¹SO₂R²、(C_1-C_6) - アルキル - フェニル、(C_1-C_6) - アルキル - ヘテロアリール、(C_1-C_6) - アルキル - 複素環、フェニル、ヘテロアリールもしくは複素環であり、最後の6個の基が各場合でハロゲン、ニトロ、シアノ、(C_1-C_6) - アルキル、ハロ - (C_1-C_6) - アルキル、(C_3-C_6) - シクロアルキル、S(O)_n - (C_1-C_6) - アルキル、(C_1-C_6) - アルコキシ、ハロ - (C_1-C_6) - アルコキシ、(C_1-C_6) - アルコキシ - (C_1-C_4) - アルキルおよびシアノメチルからなる群からのs個の基によって置換されており、複素環が0から2個のオキソ基を有しており、

Zが、ハロゲン、シアノ、ハロ - (C_1-C_6) - アルキル、(C_3-C_6) - シクロ

10

20

30

40

50

アルキル、 $S(O)_nR^2$ もしくは1, 2, 4-トリアゾール-1-イルであるか、Yが基 $S(O)_nR^2$ である場合にはZが水素、メチル、メトキシもしくはエトキシであっても良く、

Rが、(C₁-C₆) - アルキル、(C₃-C₇) - シクロアルキル、ハロ-(C₁-C₆) - アルキル、(C₃-C₇) - シクロアルキルメチル、メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチル、アセチルメチルもしくはメトキシメチルであり、またはメチル、メトキシ、トリフルオロメチルおよびハロゲンからなる群からのs個の基によって置換されたフェニルであり；

R¹が、水素、(C₁-C₆) - アルキル、(C₂-C₆) - アルケニル、(C₂-C₆) - アルキニル、(C₃-C₆) - シクロアルキル、(C₃-C₆) - シクロアルキル - (C₁-C₆) - アルキル、(C₁-C₆) - アルキル-O-(C₁-C₆) - アルキル、フェニル、フェニル - (C₁-C₆) - アルキル、ヘテロアリール、(C₁-C₆) - アルキル - ヘテロアリール、複素環、(C₁-C₆) - アルキル - 複素環、(C₁-C₆) - アルキル - O - ヘテロアリール、(C₁-C₆) - アルキル - O - 複素環、(C₁-C₆) - アルキル - NR³ - ヘテロアリールもしくは(C₁-C₆) - アルキル - NR³ - 複素環であり、最後に挙げた16個の基がシアノ、ハロゲン、ニトロ、OR³、S(O)_nR⁴、N(R³)₂、NR³OR³、COR³、OCOR³、NR³COR³、NR³SO₂R⁴、CO₂R³、CON(R³)₂および(C₁-C₄) - アルコキシ-(C₂-C₆) - アルコキシカルボニルからなる群からのs個の基によって置換されており、複素環が0から2個のオキソ基を有しており、

R²が(C₁-C₆) - アルキル、(C₃-C₆) - シクロアルキルもしくは(C₃-C₆) - シクロアルキル - (C₁-C₆) - アルキルであり、これら言及した3個の基が各場合でハロゲンおよびOR³からなる群からのs個の基によって置換されており、

R³が、水素もしくは(C₁-C₆) - アルキルであり、

R⁴が、(C₁-C₆) - アルキルであり、

nが0、1もしくは2であり、

sが0、1、2もしくは3である請求項1に記載の使用。

【請求項4】

(I) (a)カラスムギ属、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、(c)シネココッコイデアエ(*Synechococcoideae*)、(d)アミカ(*Blepharismaidae*)、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、(g)コルディア(*Kordia*)からなる生物の群の1員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードするDNA配列を含む、または(II)前記で定義の生物のHPPDコード遺伝子の1以上の突然変異DNA配列を含む1以上のキメラ遺伝子を含むことによってHPPD阻害薬型除草剤に対して耐性であるトランスジェニック作物の区域で請求項1に記載の1以上のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類を適用することを含み、当該適用を(a)望ましくない植物、(b)望ましくない植物の種子、および/または(c)その植物が成長する区域に対して行う望ましくない植物の防除方法。

【請求項5】

前記トランスジェニック作物がラッカセイ属(*Araucaria*)、フダンソウ属(*Beta*)、アブラナ属(*Brassica*)、キュウリ属(*Cucumis*)、カボチャ属(*Cucurbita*)、ヒマワリ属(*Helianthus*)、ニンジン属(*Daucus*)、ダイズ属(*Glycine*)、ワタ属(*Gossypium*)、サツマイモ属(*Ipomoea*)、アキノノゲシ属(*Lactuca*)、アマ属(*Linum*)、トマト属(*Lycopersicon*)、タバコ属(*Nicotiana*)、インゲンマメ属(*Phaseolus*)、エンドウ属(*Pisum*)、ナス属(*Solanum*)およびソラマメ属(*Vicia*)からなる双子葉作物の群に属する、またはネギ属(*Allium*)、アナナス属(*Ananas*)、アスパラガス属(*Asparagus*)、カラスムギ

属 (*Avena*)、オオムギ属 (*Hordeum*)、イネ属 (*Oryza*)、キビ属 (*Panicum*)、サトウキビ属 (*Saccharum*)、ライムギ属 (*Secale*)、モロコシ属 (*Sorghum*)、ライコムギ属 (*Triticale*)、コムギ属 (*Triticum*)、トウモロコシ属 (*Zea*) からなる単子葉作物の群に属する請求項 4 に記載の方法。

【請求項 6】

1 以上の請求項 1 に記載の N - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくは N - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類が、混合製剤またはタンクミックスでのトリケトン系もしくはピラゾリネット系除草剤からなる群から選択される 1 以上の HPPD 阻害薬型除草剤と組み合わせて、および / またはアセト乳酸シンターゼ、アセチル - CoA カルボキシラーゼ、セルロースシンターゼ、エノールピルビルシキミ酸 - 3 - リン酸シンターゼ、グルタミンシンターゼ、p - ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ、フィトエンデサチュラーゼ、光化学系 I、光化学系 II、プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼの阻害に基づく別の公知の活性物質と組み合わせて施用される、または成長調節剤として作用する請求項 4 または 5 に記載の方法。
10

【請求項 7】

1 以上の N - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくは N - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類が、テンボトリオン、メソトリオン、ビシクロピロン、テフリルトリオン、ピラスルホトール、ピラゾレート、ジケトニトリル、ベンゾフェナップまたはスルコトリオンからなる群から選択される 1 以上の HPPD 阻害薬型除草剤と組み合わせて施用される請求項 6 に記載の方法。
20

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、HPPD 阻害薬型除草剤に対して耐性であるトランスジェニック作物の区域で望ましくない植物を防除するための N - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくは N - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類またはそれらの塩の使用に関するものである。

【背景技術】

【0002】

EP10174893 (2010年9月1日に EPO で Bayer CropScience AG の名で出願) およびその相当する国際特許出願 PCT/EP2011/064820 には、いくつかの新規な N - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくは N - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類および雑草防除のための HPPD 阻害薬型除草剤としてのそれらの使用が開示されている。
30

【0003】

しかしながら、N - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくは N - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミドの除草活性はいくつかの作物に対する損傷を引き起こす可能性があり、そのため、雑草防除のための除草剤としてそれらをそのような作物が成長する区域で使用するのに制限が生じる。
40

【0004】

HPPD 阻害薬型除草剤をトウモロコシ (*Zea mays*) などの代謝耐性を示す作物におけるイネ科および / または広葉雑草に対して用いることができ、それら雑草は急速に枯死する (Schulz et al., (1993). FEBS Letters, 318, 162 - 166; Mitchell et al., (2001) Pest Management Science, Vol 57, 120 - 128; Garcia et al., (2000) Biochem., 39, 7501 - 7507; Pallett et al., (2001) Pest Management Science, Vol 57, 133 - 142)。これらの HPPD 阻害薬型除草剤の範囲を拡大するため、植物、特に代謝耐性がないか代謝耐性が低
50

い植物に対して、農学的圃場条件下で許容される耐性レベルを与えるため、いくつかの努力が行われている。

【0005】

一方、ホモゲンチシン酸のHPPD介在産生を迂回し(US6,812,010)することによりトランスジェニック植物の操作を行って、感受性酵素を過剰発現させて、植物において、除草剤に関して十分な量の標的酵素を產生させている(WO96/38567)。

【0006】

あるいは、各種位置で突然変異することでHPPDタンパク質を発現するトランスジェニック植物を発生させて、HPPのホモゲンチシン酸への変換を触媒するその特性を保持しながら、突然変異前の天然HPPDと比較してHPPD阻害薬型除草剤に対する感受性が低い標的酵素が得られている(例えばEP496630、WO99/24585を参照)。

【0007】

さらに最近では、タバコおよびダイズのプラスチドゲノムへのシードモナスHPPD遺伝子の導入が、核形質転換より有効であり、少なくとも1種類のHPPD阻害薬の発芽後施用に対する耐性ですら与えることが明らかになっている(Dufourmantel et al., 2007, Plant Biotechnol J. 5(1): 118-33)。

【0008】

WO2009/144079では、蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)HPPDタンパク質の336位の突然変異ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードする核酸配列およびHPPD阻害薬型除草剤に対する耐性である植物を得る上でのその使用が開示されている。

【0009】

WO04/024928において、発明者らは、HPP前駆体の植物細胞へのフラックスを増加させることで、その植物細胞におけるプレニルキノン合成(例えば、プラストキノン類およびトコフェロール類の合成)を増加させようと努めた。これは、前記前駆体の合成をプレフェン酸デヒドロゲナーゼ(PDH)の過剰発現によって「シキミ酸」経路に連結させることで行った。その発明者らは、PDH酵素をコードする遺伝子による植物の形質転換によって、その植物のHPPD阻害薬に対する耐性を高めることができるとも記載している。

【0010】

WO2002/046387では、HPPDをコードするカラスムギ(*Avena sativa*)から得られた遺伝子が、そのような遺伝子を過剰発現し、それによって各種HPPD阻害薬型除草剤に対する耐性を生じさせる植物を発生させることが記載されている。

【0011】

WO2008/150473では、二つの異なる耐性機序-突然変異体HPPD酵素をコードする改変カラスムギ(*Avena sativa*)遺伝子およびCYP450トウモロコシモノオキシゲナーゼ(nsf1遺伝子)-の組み合わせの例を用いて、HPPD阻害薬型除草剤に対する改善された耐性を得ているが、両方のタンパク質の組み合わせに基づく相乗効果を示すデータは全く開示されていない。

【0012】

WO2010/085705では、カラスムギ(*Avena sativa*)HPPDのいくつかの突然変異体が記載されており、そしてそのような突然変異HPPDをコードすることで、非突然変異HPPDと比較して各種HPPD阻害薬型除草剤に対する耐性を高くする遺伝子を含む植物が記載されている。

【0013】

最近、各種生物からのHPPD酵素をコードするいくつかの新規な遺伝子が確認され、

10

20

30

40

50

各種HPPD阻害薬型除草剤の施用に関して農業的に有用なレベルの耐性を示す作物を得るのに用いられている。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0014】

- 【特許文献1】EP 1 0 1 7 4 8 9 3
- 【特許文献2】U S 6 , 8 1 2 , 0 1 0
- 【特許文献3】W O 9 6 / 3 8 5 6 7
- 【特許文献4】E P 4 9 6 6 3 0
- 【特許文献5】W O 9 9 / 2 4 5 8 5
- 【特許文献6】W O 0 4 / 0 2 4 9 2 8
- 【特許文献7】W O 2 0 0 2 / 0 4 6 3 8 7
- 【特許文献8】W O 2 0 0 8 / 1 5 0 4 7 3
- 【特許文献9】W O 2 0 1 0 / 0 8 5 7 0 5

10

【非特許文献】

【0015】

- 【非特許文献1】Schulz et al., (1993). FEBS Letters, 318, 162-166.
- 【非特許文献2】Mitchell et al., (2001) Pest Management Science, Vol 57, 120-128.
- 【非特許文献3】Garcia et al., (2000) Biochem., 39, 7501-7507.
- 【非特許文献4】Pallett et al., (2001) Pest Management Science, Vol 57, 133-142.
- 【非特許文献5】Dufourmantel et al., 2007, Plant Biotechnol J. 5(1): 118-33.

20

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0016】

HPPD阻害薬型除草剤に対するそのような耐性の実現に関する研究が、下記出願番号を有する2010年12月22日のBayer CropScience AGの名の下で出願されたPCT出願(PCT/EP2010/070561(WO2011/076877)として公開；亜科シネココッコイデアエ(Synechococcoidae)に属する細菌およびそれのある種の突然変異体から得られたヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードする核酸配列に関するものである。)；PCT/EP2010/070567(WO2011/076882)として公開；ブレファリスマ(Blepharismidae)科に属する原生生物から得られるヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼをコード)；PCT/EP2010/070578(WO2011/076892)として公開；ロドコッカス(Rhodococcus)属に属する細菌およびそれのある種の突然変異体から得られるヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼをコード)；PCT/EP2010/070570(WO2011/076885)として公開；ピクロフィルス(Picrophilaceae)属に属するユリアーキオータ(Euryarchaeota)およびそれのある種の突然変異体から得られるヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼをコード)；PCT/EP2010/070575(WO2011/076889)として公開；コルディア(Kordia)属に属する細菌およびそれのある種の突然変異体から得られるヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼをコード)に広範囲に記載されており、それらはHPPD阻害薬除草剤に対する耐性を与える個々のトランスジェニック植物の生産に関する参照によって本明細書に組み込まれる。

30

【0017】

40

50

N-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミドを、HPPD阻害薬型除草剤に対する耐性を与える1以上の遺伝子を含むことでHPPD阻害薬型除草剤に対して耐性であるトランスジェニック作物に関して用いることが可能であることが認められた。

【課題を解決するための手段】

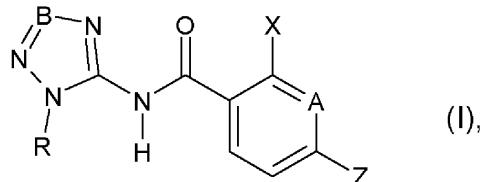
[0 0 1 8]

本発明の主題は、下記式(I)のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミドまたはそれらの塩：

【 0 0 1 9 】

【化 1】

10



「式中、

Aは、NもしくはCYであり、

Bは、NもしくはCHであり、

Xは、ニトロ、ハロゲン、シアノ、ホルミル、チオシアナト、(C₁-C₆) - アルキル、ハロ - (C₁-C₆) - アルキル、(C₂-C₆) - アルケニル、ハロ - (C₂-C₆) - アルケニル、(C₂-C₆) - アルキニル、ハロ - (C₃-C₆) - アルキニル、(C₃-C₆) - シクロアルキル、ハロ - (C₃-C₆) - シクロアルキル、(C₃-C₆) - シクロアルキル - (C₁-C₆) - アルキル、ハロ - (C₃-C₆) - シクロアルキル - (C₁-C₆) - アルキル、COR¹、COOR¹、OCOOR¹、NR¹COOR¹、C(O)N(R¹)₂、NR¹C(O)N(R¹)₂、OC(O)N(R¹)₂、C(O)NR¹OR¹、OR¹、OCOR¹、OSO₂R²、S(O)_nR²、SO₂R¹、SO₂N(R¹)₂、NR¹SO₂R²、NR¹COR¹、(C₁-C₆) - アルキル - S(O)_nR²、(C₁-C₆) - アルキル - OR¹、(C₁-C₆) - アルキル - OCOR¹、(C₁-C₆) - アルキル - OSO₂R²、(C₁-C₆) - アルキル - CO₂R¹、(C₁-C₆) - アルキル - SO₂OR¹、(C₁-C₆) - アルキル - CON(R¹)₂、(C₁-C₆) - アルキル - SO₂N(R¹)₂、(C₁-C₆) - アルキル - NR¹COR¹、(C₁-C₆) - アルキル - NR¹SO₂R²、NR₁R₂、P(O)(OR⁵)₂、CH₂P(O)(OR⁵)₂、(C₁-C₆) - アルキル - ヘテロアリール、(C₁-C₆) - アルキル - 複素環であり、最後に挙げた2個の基は各場合でs個のハロゲン、(C₁-C₆) - アルキル、ハロ - (C₁-C₆) - アルキル、S(O)_n - (C₁-C₆) - アルキル、(C₁-C₆) - アルコキシおよび/またはハロ - (C₁-C₆) - アルコキシ基によって置換されており、複素環は0から2個のオキソ基を有し、

20

Yは、水素、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、(C₁-C₆) - アルキル、ハロ - (C₁-C₆) - アルキル、(C₂-C₆) - アルケニル、ハロ - (C₂-C₆) - アルケニル、(C₂-C₆) - アルキニル、(C₃-C₆) - シクロアルキル、(C₃-C₆) - シクロアルケニル、ハロ - (C₃-C₆) - シクロアルキル、(C₃-C₆) - シクロアルキル - (C₁-C₆) - アルキル、ハロ - (C₃-C₆) - シクロアルキル - (C₁-C₆) - アルキル、COR¹、COOR¹、OCOOR¹、NR¹COOR¹、C(O)N(R¹)₂、NR¹C(O)N(R¹)₂、OC(O)N(R¹)₂、CO(NOR¹)R¹、NR¹SO₂R²、NR¹CO₂R¹、OR¹、OSO₂R²、S(O)_nR²、SO₂OR¹、SO₂N(R¹)₂(C₁-C₆) - アルキル-S(O)_nR²、(C₁-C₆) - アルキル-OR¹、(C₁-C₆) - アルキル-OCOR¹、(C₁-C₆) - アルキル-OSO₂R²、(C₁-C₆) -

40

C_6) - アルキル - CO_2R^1 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - CN 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - SO_2OR^1 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - $\text{CON}(\text{R}^1)_2$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^1)_2$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - NR^1COR^1 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - $\text{NR}^1\text{SO}_2\text{R}^2$ 、 $\text{N}(\text{R}^1)_2$ 、 $\text{P}(\text{O})(\text{OR}^5)_2$ 、 $\text{CH}_2\text{P}(\text{O})(\text{OR}^5)_2$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - フェニル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - ヘテロアリール、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - 複素環、フェニル、ヘテロアリールもしくは複素環であり、最後の 6 個の基は各場合でハロゲン、ニトロ、シアノ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、ハロ - $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ - シクロアルキル、 $\text{S}(\text{O})_n$ - $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルコキシ、ハロ - $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルコキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルコキシ - $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ - アルキルおよびシアノメチルからなる群からの s 個の基によって置換されており、複素環は 0 から 2 個のオキソ基を有しており、

Z は、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、ハロ - $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ - アルケニル、ハロ - $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ - アルケニル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ - アルキニル、ハロ - $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ - アルキニル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ - シクロアルキル、ハロ - $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ - シクロアルキル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ - シクロアルキル - $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、ハロ - $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ - シクロアルキル - $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 COR^1 、 OCOOR^1 、 NR^1COOR^1 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^1)_2$ 、 $\text{NR}^1\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^1)_2$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^1)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^1\text{OR}^1$ 、 OSO_2R^2 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^2$ 、 SO_2OR^1 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^1)_2$ 、 $\text{NR}^1\text{SO}_2\text{R}^2$ 、 NR^1COR^1 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^2$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - OR^1 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - OCOR^1 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - OSO_2R^2 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - CO_2R^1 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - SO_2OR^1 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - $\text{CON}(\text{R}^1)_2$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^1)_2$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - NR^1COR^1 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - $\text{NR}^1\text{SO}_2\text{R}^2$ 、 $\text{N}(\text{R}^1)_2$ 、 $\text{P}(\text{O})(\text{OR}^5)_2$ 、ヘテロアリール、複素環もしくはフェニルであり、最後の 3 個の基は各場合でハロゲン、ニトロ、シアノ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、ハロ - $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ - シクロアルキル、 $\text{S}(\text{O})_n$ - $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルコキシもしくはハロ - $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルコキシからなる群からの s 個の基によって置換されており、複素環は 0 から 2 個のオキソ基を有しており、または

Y が基 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^2$ である場合には、Z は水素、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキルもしくは $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルコキシであっても良く、

R は、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ - シクロアルキル、ハロ - $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ - アルケニル、ハロ - $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ - アルケニル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ - アルキニル、ハロ - $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ - アルキニル、 CH_2R^6 、ヘテロアリール、複素環もしくはフェニルであり、最後の 3 個の基は各場合でハロゲン、ニトロ、シアノ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、ハロ - $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - $\text{S}(\text{O})_n$ - $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルコキシ、ハロ - $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルコキシおよび $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルコキシ - $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ - アルキルからなる群からの s 個の基によって置換されており、

R^1 は、水素、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - ハロアルキル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ - アルケニル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ - ハロアルケニル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ - アルキニル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ - ハロアルキニル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ - シクロアルキル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ - シクロアルケニル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ - ハロシクロアルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - O - $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ - シクロアルキル - $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、フェニル、フェニル - $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル、ヘテロアリール、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - ヘテロアリール、複素環、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - 複素環、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - O - ヘテロアリール、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - O - 複素環、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - NR^3 - ヘテロアリール、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ - アルキル - NR^3

- 複素環であり、最後に挙げた 21 個の基はシアノ、ハロゲン、ニトロ、チオシアナト、 $O R^3$ 、 $S(O)_n R^4$ 、 $N(R^3)_2$ 、 $NR^3 OR^3$ 、 COR^3 、 $OCOR^3$ 、 $SCOR^4$ 、 $NR^3 COR^3$ 、 $NR^3 SO_2 R^4$ 、 $CO_2 R^3$ 、 $COSR^4$ 、 $CON(R^3)_2$ および $(C_1 - C_4) - \text{アルコキシ} - (C_2 - C_6) - \text{アルコキシカルボニル}$ からなる群からの s 個の基によって置換されており、複素環は 0 から 2 個のオキソ基を有しております。

R^2 は、 $(C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $(C_1 - C_6) - \text{ハロアルキル}$ 、 $(C_2 - C_6) - \text{アルケニル}$ 、 $(C_2 - C_6) - \text{ハロアルケニル}$ 、 $(C_2 - C_6) - \text{アルキニル}$ 、 $(C_2 - C_6) - \text{ハロアルキニル}$ 、 $(C_3 - C_6) - \text{シクロアルキル}$ 、 $(C_3 - C_6) - \text{シクロアルケニル}$ 、 $(C_3 - C_6) - \text{ハロシクロアルキル}$ 、 $(C_1 - C_6) - \text{アルキル-O-(C}_1 - C_6)$ - アルキル、 $(C_3 - C_6) - \text{シクロアルキル-(C}_1 - C_6)$ - アルキル、フェニル、フェニル - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、ヘテロアリール、 $(C_1 - C_6) - \text{アルキル-ヘテロアリール}$ 、複素環、 $(C_1 - C_6) - \text{アルキル-複素環}$ 、 $(C_1 - C_6) - \text{アルキル-O-アルキル-O-複素環}$ 、 $(C_1 - C_6) - \text{アルキル-NR}^3 - \text{ヘテロアリール}$ 、 $(C_1 - C_6) - \text{アルキル-NR}^3 - \text{複素環}$ であり、最後に挙げた 21 個の基はシアノ、ハロゲン、ニトロ、チオシアナト、 $O R^3$ 、 $S(O)_n R^4$ 、 $N(R^3)_2$ 、 $NR^3 OR^3$ 、 COR^3 、 $OCOR^3$ 、 $SCOR^4$ 、 $NR^3 COR^3$ 、 $NR^3 SO_2 R^4$ 、 $CO_2 R^3$ 、 $COSR^4$ 、 $CON(R^3)_2$ および $(C_1 - C_4) - \text{アルコキシ} - (C_2 - C_6) - \text{アルコキシカルボニル}$ からなる群からの s 個の基によって置換されており、複素環は 0 から 2 個のオキソ基を有しております。

R^3 は、水素、 $(C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $(C_2 - C_6) - \text{アルケニル}$ 、 $(C_2 - C_6) - \text{アルキニル}$ 、 $(C_3 - C_6) - \text{シクロアルキル}$ もしくは $(C_3 - C_6) - \text{シクロアルキル-(C}_1 - C_6)$ - アルキルであり、

R^4 は、 $(C_1 - C_6) - \text{アルキル}$ 、 $(C_2 - C_6) - \text{アルケニル}$ もしくは $(C_2 - C_6) - \text{アルキニル}$ であり、

R^5 は、メチルもしくはエチルであり、

R^6 は、アセトキシ、アセトアミド、N - メチルアセトアミド、ベンゾイルオキシ、ベンズアミド、N - メチルベンズアミド、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ベンゾイル、メチルカルボニル、ピペリジニルカルボニル、モルホリニルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、 $(C_1 - C_6) - \text{アルコキシ}$ もしくは $(C_3 - C_6) - \text{シクロアルキル}$ であり、または各場合でメチル、エチル、メトキシ、トリフルオロメチルおよびハロゲンからなる群からの s 個の基によって置換されているヘテロアリール、複素環もしくはフェニルであり、

n は 0、1 もしくは 2 であり、

s は 0、1、2 もしくは 3 である。] の使用であって、(I)(a)カラスムギ属、好ましくはカラスムギ (Avena sativa)、より好ましくは配列番号 2 によって定義される HPPD をコードする配列番号 1 と同一の DNA 配列を含むもの、(b)シードモナス (Pseudomonas)、好ましくは蛍光菌 (Pseudomonas fluorescens)、より好ましくは配列番号 4 によって定義される HPPD をコードする配列番号 3 と同一の DNA 配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ (Synechococcus coideae)、好ましくはシネココッカス (Synechococcus) 属種、より好ましくは配列番号 7 によって定義される HPPD をコードする配列番号 6 と同一の DNA 配列を含むもの、(d)アミカ (Blepharisma)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム (Blepharisma japonicum)、より好ましくは配列番号 9 によって定義される HPPD をコードする配列番号 8 と同一の DNA 配列を含むもの、(e)ロドコッカス (Rhodococcus)、好ましくはロドコッカス (Rhodococcus) 属種 (RHA1 株)、分離株 r003041、より好ましくは配列番号 11 によって定義される HPPD をコードする配列番号 10 と同一の DNA 配列またはロドコッカス (Rhodococcus) 属種 (RHA1 株)、分離株 r002040、より好ましくは配列番号 13 によって定義される HPPD を

コードする配列番号 12 と同一の DNA 配列を含むもの、(f) ピクロフィルス科 (Picrophilaceae)、好ましくはピクロフィルス・トリズス (Picrophilus torridus)、より好ましくは配列番号 15 によって定義される HPPD をコードする配列番号 14 と同一の DNA 配列を含むもの、(g) コルディア (Kordia)、好ましくはコルディア・アルギシダ (Kordia algicida)、より好ましくは配列番号 17 によって定義される HPPD をコードする配列番号 16 と同一の DNA 配列を含むものからなる生物の群の 1 構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ (HPPD) をコードする DNA 配列を含み、または (II) 前記で定義の生物の HPPD をコードする遺伝子の 1 以上の突然変異 DNA 配列、好ましくは WO 2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、または PCT/EP2010/070575 に記載の突然変異体を含むものを含む 1 以上のキメラ遺伝子を含むことで HPPD 阻害薬型除草剤に対して耐性であるトランスジェニック作物の区域において望ましくない植物を防除するための使用である。
10

【発明を実施するための形態】

【0020】

式 (I) および下記の全ての式において、2 個より多い炭素原子を有するアルキル基は直鎖もしくは分岐ができる。アルキル基は、例えば、メチル、エチル、n- もしくはイソプロピル、n-、イソ-、t- もしくは 2 - ブチル、ペンチル類、ヘキシリ類、例えば n - ヘキシリ、イソヘキシリおよび 1 , 3 - ジメチルブチルである。ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素もしくはヨウ素である。
20

【0021】

複素環は、3 から 6 個の環原子を含み、そのうちの 1 から 4 個が酸素、窒素および硫黄からなる群からのものであり、さらにベンゾ環によって縮合していることができる飽和、部分飽和または完全不飽和の環状基である。例えば、複素環は、ピペリジニル、ピロリジニル、テトラヒドロフラニル、ジヒドロフラニル、4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イルおよびオキセタニルである。

【0022】

ヘテロアリールは、3 から 6 個の環原子を含み、そのうちの 1 から 4 個が酸素、窒素および硫黄からなる群からのものであり、さらにベンゾ環によって縮合していることができる芳香族環状基である。例えば、ヘテロアリールは、ベンズイミダゾール - 2 - イル、フラニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピリジニル、ベンゾイソオキサゾリル、チアゾリル、ピロリル、ピラゾリル、チオフェニル、1 , 2 , 3 - オキサジアゾリル、1 , 2 , 4 - オキサジアゾリル、1 , 2 , 5 - オキサジアゾリル、1 , 3 , 4 - オキサジアゾリル、1 , 2 , 4 - トリアゾリル、1 , 2 , 3 - トリアゾリル、1 , 2 , 5 - トリアゾリル、1 , 3 , 4 - トリアゾリル、1 , 2 , 4 - トリアゾリル、1 , 2 , 4 - チアジアゾリル、1 , 3 , 4 - チアジアゾリル、1 , 2 , 3 - チアジアゾリル、1 , 2 , 5 - チアジアゾリル、2H - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラゾリル、1H - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラゾリル、1 , 2 , 3 , 4 - オキサトリアゾリル、1 , 2 , 3 , 5 - オキサトリアゾリル、1 , 2 , 3 , 4 - チアトリアゾリルおよび 1 , 2 , 3 , 5 - チアトリアゾリルである。
30
40

【0023】

ある基が複数の基によって置換されている場合、それは、この基が、言及された基の 1 以上の同一もしくは異なる代表的なものによって置換されていることを意味する。

【0024】

置換基の性質および結合に応じて、式 (I) の化合物は立体異性体として存在することができる。例えば 1 以上の不斉炭素原子が存在する場合、エナンチオマーおよびジアステレオマーがあり得る。n が 1 である場合 (スルホキシド) も立体異性体が存在し得る。立体異性体は、一般的な分離方法を用いて、例えばクロマトグラフィー分離技術によって、
50

製造から得られる混合物から得ることができる。光学活性な原材料および／または補助剤を用いる立体選択的反応を用いることで、立体異性体を選択的に製造することも可能である。本発明は、一般式(Ⅰ)によって包含されるが具体的に定義されていない全ての立体異性体およびそれらの混合物に関するものもある。

【0025】

好みいのは、

AがNもしくはCYであり、

BがNもしくはCHであり、

Xが、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、(C₁-C₆) - アルキル、ハロ-(C₁-C₆) - アルキル、(C₂-C₆) - アルケニル、ハロ-(C₂-C₆) - アルケニル、(C₂-C₆) - アルキニル、ハロ-(C₃-C₆) - アルキニル、(C₃-C₆) - シクロアルキル、ハロ-(C₃-C₆) - シクロアルキル、(C₁-C₆) - アルキル-O-(C₁-C₆) - アルキル、(C₃-C₆) - シクロアルキル-(C₁-C₆) - アルキル、ハロ-(C₃-C₆) - シクロアルキル-(C₁-C₆) - アルキル、COR¹、OR¹、OCOR¹、OSO₂R²、S(O)_nR²、SO₂OR¹、SO₂N(R¹)₂、NR¹SO₂R²、NR¹COR¹、(C₁-C₆) - アルキル-S(O)nR²、(C₁-C₆) - アルキル-OR¹、(C₁-C₆) - アルキル-OCOR¹、(C₁-C₆) - アルキル-OSO₂R²、(C₁-C₆) - アルキル-CO₂R¹、(C₁-C₆) - アルキル-SO₂OR¹、(C₁-C₆) - アルキル-CON(R¹)₂、(C₁-C₆) - アルキル-SO₂N(R¹)₂、(C₁-C₆) - アルキル-NR¹COR¹もしくは(C₁-C₆) - アルキル-NR¹SO₂R²、(C₁-C₆) - アルキル-ヘテロアリール、(C₁-C₆) - アルキル-複素環であり、最後に挙げた2個の基が各場合でs個のハロゲン、(C₁-C₆) - アルキル、ハロ-(C₁-C₆) - アルキル、S(O)_n-(C₁-C₆) - アルキル、(C₁-C₆) - アルコキシおよび／またはハロ-(C₁-C₆) - アルコキシ基によって置換されており、複素環が0から2個のオキソ基を有しており、

Yが、水素、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、(C₁-C₆) - アルキル、ハロ-(C₁-C₆) - アルキル、(C₂-C₆) - アルケニル、ハロ-(C₂-C₆) - アルケニル、(C₂-C₆) - アルキニル、ハロ-(C₃-C₆) - アルキニル、(C₃-C₆) - シクロアルキル、(C₃-C₆) - シクロアルケニル、ハロ-(C₃-C₆) - シクロアルキル、(C₁-C₆) - アルキル、ハロ-(C₃-C₆) - シクロアルキル-(C₁-C₆) - アルキル、COR¹、OR¹、COOR¹、OSO₂R²、S(O)_nR²、SO₂OR¹、SO₂N(R¹)₂、NR¹SO₂R²、NR¹COR¹、(C₁-C₆) - アルキル-S(O)_nR²、(C₁-C₆) - アルキル-OR¹、(C₁-C₆) - アルキル-OCOR¹、(C₁-C₆) - アルキル-OSO₂R²、(C₁-C₆) - アルキル-CO₂R¹、(C₁-C₆) - アルキル-SO₂OR¹、(C₁-C₆) - アルキル-CON(R¹)₂、(C₁-C₆) - アルキル-SO₂N(R¹)₂、(C₁-C₆) - アルキル-NR¹COR¹、(C₁-C₆) - アルキル-NR¹SO₂R²、(C₁-C₆) - アルキル-フェニル、(C₁-C₆) - アルキル-ヘテロアリール、(C₁-C₆) - アルキル-複素環、フェニル、ヘテロアリールもしくは複素環であり、最後の6個の基が各場合でハロゲン、ニトロ、シアノ、(C₁-C₆) - アルキル、ハロ-(C₁-C₆) - アルキル、(C₃-C₆) - シクロアルキル、S(O)_n-(C₁-C₆) - アルキル、(C₁-C₆) - アルコキシ、ハロ-(C₁-C₆) - アルコキシ、(C₁-C₆) - アルコキシ-(C₁-C₄) - アルキルおよびシアノメチルからなる群からのs個の基によって置換されており、複素環が0から2個のオキソ基を有しており、

Zが、ハロゲン、シアノ、チオシアナト、ハロ-(C₁-C₆) - アルキル、(C₂-C₆) - アルケニル、ハロ-(C₂-C₆) - アルケニル、(C₂-C₆) - アルキニル、ハロ-(C₃-C₆) - アルキニル、(C₃-C₆) - シクロアルキル、ハロ-(C₃-C₆) - シクロアルキル、(C₁-C₆) - アルキル

ル、ハロ - (C₃ - C₆) - シクロアルキル - (C₁ - C₆) - アルキル、COR¹、COOR¹、C(O)N(R¹)₂、C(O)NR¹OR¹、OSO₂R²、S(O)_nR²、SO₂OR¹、SO₂N(R¹)₂、NR¹SO₂R²、NR¹COR¹、(C₁ - C₆) - アルキル - S(O)_nR²、(C₁ - C₆) - アルキル - OR¹、(C₁ - C₆) - アルキル - OCOR¹、(C₁ - C₆) - アルキル - OSO₂R²、(C₁ - C₆) - アルキル - CO₂R¹、(C₁ - C₆) - アルキル - SO₂OR¹、(C₁ - C₆) - アルキル - CON(R¹)₂、(C₁ - C₆) - アルキル - SO₂N(R¹)₂、(C₁ - C₆) - アルキル - NR¹COR¹、(C₁ - C₆) - アルキル - NR¹SO₂R²もしくは1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルであり、または

Yが基S(O)_nR²である場合に、Zが水素、(C₁ - C₆) - アルキルもしくは(C₁ - C₆) - アルコキシであっても良く、

Rが、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₇) - シクロアルキル、ハロ - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₇) - シクロアルキルメチル、メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチル、アセチルメチル、メトキシメチルまたはフェニルもしくはベンジルであり、それらはそれぞれメチル、メトキシ、トリフルオロメチルおよびハロゲンからなる群からのs個の基によって置換されており、

R¹が、水素、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキル - O - (C₁ - C₆) - アルキル、フェニル、フェニル - (C₁ - C₆) - アルキル、ヘテロアリール、(C₁ - C₆) - アルキル - ヘテロアリール、複素環、(C₁ - C₆) - アルキル - 複素環、(C₁ - C₆) - アルキル - O - ヘテロアリール、(C₁ - C₆) - アルキル - O - 複素環、(C₁ - C₆) - アルキル - NR³ - ヘテロアリールもしくは(C₁ - C₆) - アルキル - NR³ - 複素環であり、最後に挙げた16個の基がシアノ、ハロゲン、ニトロ、OR³、S(O)_nR⁴、N(R³)₂、NR³OR³、COR³、OCOR³、NR³COR³、NR³SO₂R⁴、CO₂R³、CON(R³)₂および(C₁ - C₄) - アルコキシ - (C₂ - C₆) - アルコキシカルボニルからなる群からのs個の基によって置換されており、複素環が0から2個のオキソ基を有しており、

R²が、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル - (C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルキル - O - (C₁ - C₆) - アルキル、フェニル、フェニル - (C₁ - C₆) - アルキル、ヘテロアリール、(C₁ - C₆) - アルキル - ヘテロアリール、複素環、(C₁ - C₆) - アルキル - 複素環、(C₁ - C₆) - アルキル - O - ヘテロアリール、(C₁ - C₆) - アルキル - O - 複素環、(C₁ - C₆) - アルキル - NR³ - ヘテロアリールもしくは(C₁ - C₆) - アルキル - NR³ - 複素環であり、これらの基がシアノ、ハロゲン、ニトロ、OR³、S(O)_nR⁴、N(R³)₂、NR³OR³、NR³SO₂R⁴、COR³、OCOR³、NR³COR³、CO₂R³、CON(R³)₂および(C₁ - C₄) - アルコキシ - (C₂ - C₆) - アルコキシカルボニルからなる群からのs個の基によって置換されており、複素環が0から2個のオキソ基を有しております、

R³が、水素、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキルもしくは(C₃ - C₆) - シクロアルキル - (C₁ - C₆) - アルキルであり、

R⁴が、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニルもしくは(C₂ - C₆) - アルキニルであり、

nが0、1もしくは2であり、

sが0、1、2もしくは3である一般式(I)のN - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくはN - (トリアゾール - 3 - イル)アリールカルボキサミドの本発明による使用であつて、(I)(a)カラスマギ属、好ましくはカラスマギ(Avena sativa)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一

のDNA配列を含むもの、(b)ショードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ(*Synechococcoideae*)、好ましくはシネココッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(*Blepharismaidae*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードするDNA配列を含み、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、U.S. 245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含むものを含む1以上のキメラ遺伝子を含むことでHPPD阻害薬型除草剤に対して耐性であるトランスジェニック作物の区域において望ましくない植物を防除するための使用である。

【0026】

特に好ましいのは、

30

AがNもしくはCYであり、

BがNもしくはCHであり、

Xが、ニトロ、ハロゲン、シアノ、(C₁-C₆) - アルキル、ハロ-(C₁-C₆) - アルキル、(C₃-C₆) - シクロアルキル、OR¹、S(O)_nR²、(C₁-C₆) - アルキル-S(O)_nR²、(C₁-C₆) - アルキル-OR¹、(C₁-C₆) - アルキル-CO(NR¹)₂、(C₁-C₆) - アルキル-SO₂N(R¹)₂、(C₁-C₆) - アルキル-NR¹COR¹、(C₁-C₆) - アルキル-NR¹SO₂R²、(C₁-C₆) - アルキル-ヘテロアリールもしくは(C₁-C₆) - アルキル-複素環であり、最後に挙げた2個の基が各場合でs個のハロゲン、(C₁-C₆) - アルキル、ハロ-(C₁-C₆) - アルキル、S(O)_n - (C₁-C₆) - アルキル、(C₁-C₆) - アルコキシおよび/またはハロ-(C₁-C₆) - アルコキシ基によって置換されており、複素環が0から2個のオキソ基を有しており、

40

Yが、水素、ニトロ、ハロゲン、シアノ、(C₁-C₆) - アルキル、(C₁-C₆) - ハロアルキル、OR¹、S(O)_nR²、SO₂N(R¹)₂、N(R¹)₂、NR¹SO₂R²、NR¹COR¹、(C₁-C₆) - アルキル-S(O)_nR²、(C₁-C₆) - アルキル-OR¹、(C₁-C₆) - アルキル-CO(NR¹)₂、(C₁-C₆) - アルキル-SO₂N(R¹)₂、(C₁-C₆) - アルキル-NR¹COR¹、(C₁-C₆) - アルキル-NR¹SO₂R²、(C₁-C₆) - アルキル-フェニル、(C₁-C₆) - アルキル-ヘテロアリール、(C₁-C₆) - アルキル-複素環、フェニル、ヘテロアリールもしくは複素環であり、最後の6個の基が各場合でハロゲン、ニトロ、

50

シアノ、(C₁-C₆) - アルキル、ハロ - (C₁-C₆) - アルキル、(C₃-C₆) - シクロアルキル、S(O)_n - (C₁-C₆) - アルキル、(C₁-C₆) - アルコキシ、ハロ - (C₁-C₆) - アルコキシ、(C₁-C₆) - アルコキシ - (C₁-C₄) - アルキルおよびシアノメチルからなる群からのs個の基によって置換されており、複素環が0から2個のオキソ基を有しており、

Zが、ハロゲン、シアノ、ハロ - (C₁-C₆) - アルキル、(C₃-C₆) - シクロアルキル、S(O)_nR²もしくは1,2,4-トリアゾール-1-イルであるか、Yが基S(O)_nR²である場合にはZが水素、メチル、メトキシもしくはエトキシであっても良く、

Rが、(C₁-C₆) - アルキル、(C₃-C₇) - シクロアルキル、ハロ - (C₁-C₆) - アルキル、(C₃-C₇) - シクロアルキルメチル、メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチル、アセチルメチルもしくはメトキシメチルであり、またはメチル、メトキシ、トリフルオロメチルおよびハロゲンからなる群からのs個の基によって置換されたフェニルであり；

R¹が、水素、(C₁-C₆) - アルキル、(C₂-C₆) - アルケニル、(C₂-C₆) - アルキニル、(C₃-C₆) - シクロアルキル、(C₃-C₆) - シクロアルキル - (C₁-C₆) - アルキル、(C₁-C₆) - アルキル - O - (C₁-C₆) - アルキル、フェニル、フェニル - (C₁-C₆) - アルキル、ヘテロアリール、(C₁-C₆) - アルキル - ヘテロアリール、複素環、(C₁-C₆) - アルキル - 複素環、(C₁-C₆) - アルキル - O - ヘテロアリール、(C₁-C₆) - アルキル - O - 複素環、(C₁-C₆) - アルキル - NR³ - ヘテロアリールもしくは(C₁-C₆) - アルキル - NR³ - 複素環であり、最後に挙げた16個の基がシアノ、ハロゲン、ニトロ、OR³、S(O)_nR⁴、N(R³)₂、NR³OR³、COR³、OCOR³、NR³COR³、NR³SO₂R⁴、CO₂R³、CON(R³)₂および(C₁-C₄) - アルコキシ - (C₂-C₆) - アルコキシカルボニルからなる群からのs個の基によって置換されており、複素環が0から2個のオキソ基を有しており、

R²が(C₁-C₆) - アルキル、(C₃-C₆) - シクロアルキルもしくは(C₃-C₆) - シクロアルキル - (C₁-C₆) - アルキルであり、これら言及した3個の基が各場合でハロゲンおよびOR³からなる群からのs個の基によって置換されており、

R³が、水素もしくは(C₁-C₆) - アルキルであり、

R⁴が、(C₁-C₆) - アルキルであり、

nが0、1もしくは2であり、

sが0、1、2もしくは3である一般式(I)のN - (テトラゾール-4-イル) - もしくはN - (トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミドの本発明による使用であつて、(I)(a)カラスムギ属、好ましくはカラスムギ(Avena sativa)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)ショードモナス(Pseudomonas)、好ましくは蛍光菌(Pseudomonas fluorescens)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ(Synechococcoidae)、好ましくはシネコッカス(Synechococcus)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(Blepharismaidae)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム(Blepharisma japonicum)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(Rhodococcus)、好ましくはロドコッカス(Rhodococcus)属種(RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(Rhodococcus)属種(RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含む

10

20

30

40

50

もの、(f) ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g) コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードするDNA配列を含み、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含むものを含む1以上のキメラ遺伝子を含むことでHPPD阻害薬型除草剤に対して耐性であるトランスジェニック作物の区域において望ましくない植物を防除するための使用である。
【0027】

下記の全ての式において、別段の断りがない限り、置換基および記号は式(I)下に記載のものと同じ定義を有する。

【0028】

本発明に従って使用される化合物は、欧州特許出願「EP10174893」(2010年9月1日にEPOでBayer CropScience AGの名の下で出願)およびその相当する国際特許出願PCT/EP2011/064820に詳細に記載されている方法に従って製造することができ、これら出願は参照によって本明細書に組み込まれる。

【0029】

下記の表中で列記した化合物は、(I)(a)カラスマギ属、好ましくはカラスマギ(*Avena sativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ(*Synechococcus ideae*)、好ましくはシネココッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(*Blepharisma midae*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株ro03041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株ro02040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードするDNA配列を含み、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/0

7 0 5 6 1、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 6 7、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7
 8、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 0、またはP C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 5
 に記載の突然変異体を含むものを含む1以上のキメラ遺伝子を含むトランスジェニック植物
 の区域において望ましくない植物を防除するのに用いる上で非常に特別に好ましいもの
 である。

【0030】

使用される略称は次の通りである。

【0031】

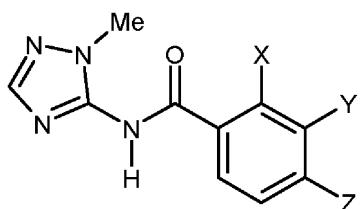
E t = エチル、M e = メチル、n - P r = n - プロピル、i - P r = イソプロピル、c - P r = シクロプロピル、P h = フェニル、A c = アセチル、B z = ベンゾイル。 10

【0032】

表1：AがC Yであり、BがC Hであり、Rがメチルである本発明による一般式(I)の化合物。

【0033】

【化2】



10

20

【0034】

【表1】

No.	X	Y	Z
1-1	F	H	Cl
1-2	F	H	Br
1-3	F	H	SO ₂ Me
1-4	F	H	SO ₂ Et
1-5	F	H	CF ₃
1-6	F	H	NO ₂
1-7	Cl	H	F
1-8	Cl	H	Cl
1-9	Cl	H	Br
1-10	Cl	H	SMe
1-11	Cl	H	SOMe
1-12	Cl	H	SO ₂ Me
1-13	Cl	H	SO ₂ CH ₂ Cl
1-14	Cl	H	SEt
1-15	Cl	H	SO ₂ Et
1-16	Cl	H	CF ₃
1-17	Cl	H	NO ₂
1-18	Cl	H	ピラゾール-1-イル
1-19	Cl	H	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
1-20	Br	H	Cl
1-21	Br	H	Br
1-22	Br	H	SO ₂ Me
1-23	Br	H	SO ₂ Et
1-24	Br	H	CF ₃
1-25	SO ₂ Me	H	Cl
1-26	SO ₂ Me	H	Br
1-27	SO ₂ Me	H	SMe
1-28	SO ₂ Me	H	SOMe
1-29	SO ₂ Me	H	SO ₂ Me
1-30	SO ₂ Me	H	SO ₂ Et
1-31	SO ₂ Me	H	CF ₃
1-32	SO ₂ Et	H	Cl
1-33	SO ₂ Et	H	Br
1-34	SO ₂ Et	H	SMe
1-35	SO ₂ Et	H	SOMe
1-36	SO ₂ Et	H	SO ₂ Me

10

20

30

No.	X	Y	Z
1-37	SO ₂ Et	H	CF ₃
1-38	NO ₂	H	F
1-39	NO ₂	H	Cl
1-40	NO ₂	H	Br
1-41	NO ₂	H	I
1-42	NO ₂	H	CN
1-43	NO ₂	H	SO ₂ Me
1-44	NO ₂	H	SO ₂ Et
1-45	NO ₂	H	CF ₃
1-46	Me	H	Cl
1-47	Me	H	Br
1-48	Me	H	SMe
1-49	Me	H	SO ₂ Me
1-50	Me	H	SO ₂ CH ₂ Cl
1-51	Me	H	SEt
1-52	Me	H	SO ₂ Et
1-53	Me	H	CF ₃
1-54	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃
1-55	Et	H	Cl
1-56	Et	H	Br
1-57	Et	H	SMe
1-58	Et	H	SO ₂ Me
1-59	Et	H	SO ₂ CH ₂ Cl
1-60	Et	H	SEt
1-61	Et	H	SO ₂ Et
1-62	Et	H	CF ₃
1-63	CF ₃	H	Cl
1-64	CF ₃	H	Br
1-65	CF ₃	H	SO ₂ Me
1-66	CF ₃	H	SO ₂ Et
1-67	CF ₃	H	CF ₃
1-68	NO ₂	NH ₂	F
1-69	NO ₂	NHMe	F
1-70	NO ₂	NMe ₂	F
1-71	NO ₂	Me	Cl
1-72	NO ₂	NH ₂	Cl
1-73	NO ₂	NHMe	Cl
1-74	NO ₂	NMe ₂	Cl
1-75	NO ₂	NH ₂	Br
1-76	NO ₂	NHMe	Br
1-77	NO ₂	NMe ₂	Br
1-78	NO ₂	NH ₂	CF ₃
1-79	NO ₂	NMe ₂	CF ₃
1-80	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Me
1-81	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Et
1-82	NO ₂	NHMe	SO ₂ Me
1-83	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Me
1-84	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Et

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
1-85	NO ₂	NH ₂	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
1-86	NO ₂	NHMe	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
1-87	NO ₂	NMe ₂	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
1-88	Me	SMe	H
1-89	Me	SOMe	H
1-90	Me	SO ₂ Me	H
1-91	Me	SEt	H
1-92	Me	SOEt	H
1-93	Me	SO ₂ Et	H
1-94	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	H
1-95	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	H
1-96	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	H
1-97	Me	F	F
1-98	Me	F	Cl
1-99	Me	SEt	F
1-100	Me	SOEt	F
1-101	Me	SO ₂ Et	F
1-102	Me	Me	Cl
1-103	Me	F	Cl
1-104	Me	Cl	Cl
1-105	Me	NH ₂	Cl
1-106	Me	NHMe	Cl
1-107	Me	NMe ₂	Cl
1-108	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-109	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
1-110	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	Cl
1-111	Me	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
1-112	Me	O(CH ₂) ₂ -CO-NMe ₂	Cl
1-113	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂	Cl
1-114	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NHCO ₂ Et	Cl
1-115	Me	O(CH ₂) ₂ -NHCO ₂ Me	Cl
1-116	Me	OCH ₂ -NHSO ₂ cPr	Cl
1-117	Me	O(CH ₂) ₅ -2,4-ジメチル-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オノン	Cl
1-118	Me	O(CH ₂) ₃ -5-ジメチル-1,2-オキサゾール-4-イル	Cl
1-119	Me	SMe	Cl
1-120	Me	SOMe	Cl
1-121	Me	SO ₂ Me	Cl
1-122	Me	SEt	Cl
1-123	Me	SOEt	Cl
1-124	Me	SO ₂ Et	Cl
1-125	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-126	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
1-127	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-128	Me	NH ₂	Br
1-129	Me	NHMe	Br
1-130	Me	NMe ₂	Br
1-131	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	Br
1-132	Me	O(CH ₂)-5-ピロリジン-2-オ ン	Br
1-133	Me	SMe	Br
1-134	Me	SOMe	Br
1-135	Me	SO ₂ Me	Br
1-136	Me	SEt	Br
1-137	Me	SOEt	Br
1-138	Me	SO ₂ Et	Br
1-139	Me	SMe	I
1-140	Me	SOMe	I
1-141	Me	SO ₂ Me	I
1-142	Me	SEt	I
1-143	Me	SOEt	I
1-144	Me	SO ₂ Et	I
1-145	Me	Cl	CF ₃
1-146	Me	SMe	CF ₃
1-147	Me	SOMe	CF ₃
1-148	Me	SO ₂ Me	CF ₃
1-149	Me	SEt	CF ₃
1-150	Me	SOEt	CF ₃
1-151	Me	SO ₂ Et	CF ₃
1-152	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
1-153	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
1-154	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
1-155	Me	Me	SO ₂ Me
1-156	Me	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾ ール-3-イル	SO ₂ Me
1-157	Me	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾ ール-3-イル	SO ₂ Et
1-158	Me	5-シアノメチル-4,5-ジヒド ロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
1-159	Me	5-シアノメチル-4,5-ジヒド ロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
1-160	Me	NH ₂	SO ₂ Me
1-161	Me	NHMe	SO ₂ Me
1-162	Me	NMe ₂	SO ₂ Me
1-163	Me	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-164	Me	ピラゾール-1-イル	SO ₂ Me
1-165	Me	OH	SO ₂ Me
1-166	Me	OMe	SO ₂ Me
1-167	Me	OMe	SO ₂ Et
1-168	Me	OEt	SO ₂ Me
1-169	Me	OEt	SO ₂ Et

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
1-170	Me	OiPr	SO ₂ Me
1-171	Me	OiPr	SO ₂ Et
1-172	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-173	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
1-174	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
1-175	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
1-176	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
1-177	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
1-178	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Me
1-179	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Et
1-180	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
1-181	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
1-182	Me	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Me
1-183	Me	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Et
1-184	Me	O(CH ₂) ₂ -O(3,5-ジメトキシピリミジン-2-イル	SO ₂ Me
1-185	Me	Cl	SO ₂ Me
1-186	Me	SMe	SO ₂ Me
1-187	Me	SOMe	SO ₂ Me
1-188	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
1-189	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Et
1-190	Me	SEt	SO ₂ Me
1-191	Me	SOEt	SO ₂ Me
1-192	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me
1-193	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-194	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-195	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-196	CH ₂ SMe	OMe	SO ₂ Me
1-197	CH ₂ OMe	OMe	SO ₂ Me
1-198	CH ₂ O(CH ₂) ₂ O Me	NH(CH ₂) ₂ OEt	SO ₂ Me
1-199	CH ₂ O(CH ₂) ₂ O Me	NH(CH ₂) ₃ OEt	SO ₂ Me
1-200	CH ₂ O(CH ₂) ₃ O Me	OMe	SO ₂ Me
1-201	CH ₂ O(CH ₂) ₂ O Me	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-202	CH ₂ O(CH ₂) ₂ O Me	NH(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
1-203	Et	SMe	Cl
1-204	Et	SO ₂ Me	Cl
1-205	Et	SMe	CF ₃
1-206	Et	SO ₂ Me	CF ₃
1-207	Et	F	SO ₂ Me
1-208	Et	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-209	iPr	SO ₂ Me	CF ₃

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
1-210	cPr	SO ₂ Me	CF ₃
1-211	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	F
1-212	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	F
1-213	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	F
1-214	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	F
1-215	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-216	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
1-217	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
1-218	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	Cl
1-219	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Br
1-220	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Br
1-221	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Br
1-222	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	Br
1-223	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	I
1-224	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	I
1-225	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	I
1-226	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	I
1-227	CF ₃	F	SO ₂ Me
1-228	CF ₃	F	SO ₂ Et
1-229	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-230	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
1-231	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
1-232	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
1-233	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Me
1-234	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Et
1-235	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Me
1-236	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Et
1-237	F	SMe	CF ₃
1-238	F	SOMe	CF ₃
1-239	Cl	Me	Cl
1-240	Cl	OCH ₂ CHCH ₂	Cl
1-241	Cl	OCH ₂ CHF ₂	Cl
1-242	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-243	Cl	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
1-244	Cl	O(CH ₂) ₅ -ピロリジン-2-オ ン	Cl
1-245	Cl	SMe	Cl
1-246	Cl	SOMe	Cl
1-247	Cl	SO ₂ Me	Cl
1-248	Cl	F	SMe
1-249	Cl	Cl	SO ₂ Me
1-250	Cl	COOMe	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
1-251	Cl	CONMe ₂	SO ₂ Me
1-252	Cl	CONMe(OMe)	SO ₂ Me
1-253	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me
1-254	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Et
1-255	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Me
1-256	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Et
1-257	Cl	CH ₂ OCH ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
1-258	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
1-259	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et
1-260	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
1-261	Cl	CH ₂ Oc-ペンチル	SO ₂ Me
1-262	Cl	CH ₂ PO(OMe) ₂	SO ₂ Me
1-263	Cl	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SMe
1-264	Cl	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
1-265	Cl	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
1-266	Cl	5-シアノメチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
1-267	Cl	5-シアノメチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
1-268	Cl	5-(メトキシメチル)-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
1-269	Cl	5-(メトキシメチル)-5-メチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
1-270	Cl	CH ₂ O-テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Me
1-271	Cl	CH ₂ O-テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Et
1-272	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-2-イル	SO ₂ Me
1-273	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-2-イル	SO ₂ Et
1-274	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Me
1-275	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Et
1-276	Cl	OMe	SO ₂ Me
1-277	Cl	OMe	SO ₂ Et
1-278	Cl	OEt	SO ₂ Me
1-279	Cl	OEt	SO ₂ Et
1-280	Cl	OiPr	SO ₂ Me
1-281	Cl	OiPr	SO ₂ Et
1-282	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-283	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
1-284	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
1-285	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
1-286	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
1-287	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-288	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
1-289	Cl	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Me
1-290	Cl	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Et
1-291	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
1-292	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
1-293	Cl	SMe	SO ₂ Me
1-294	Cl	SOMe	SO ₂ Me
1-295	Br	OMe	Br
1-296	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	Br
1-297	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-298	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
1-299	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
1-300	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
1-301	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
1-302	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
1-303	Br	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Me
1-304	Br	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Et
1-305	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-306	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
1-307	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
1-308	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
1-309	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
1-310	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
1-311	I	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Me
1-312	I	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Et
1-313	OMe	SMe	CF ₃
1-314	OMe	SOMe	CF ₃
1-315	OMe	SO ₂ Me	CF ₃
1-316	OMe	SOEt	CF ₃
1-317	OMe	SO ₂ Et	CF ₃
1-318	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
1-319	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
1-320	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
1-321	OMe	SMe	Cl
1-322	OMe	SOMe	Cl
1-323	OMe	SO ₂ Me	Cl
1-324	OMe	SEt	Cl
1-325	OMe	SOEt	Cl

10

20

30

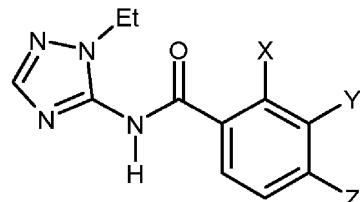
40

No.	X	Y	Z
1-326	OMe	SO ₂ Et	Cl
1-327	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-328	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-329	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-330	OCH ₂ c-Pr	SMe	CF ₃
1-331	OCH ₂ c-Pr	SOME	CF ₃
1-332	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	CF ₃
1-333	OCH ₂ c-Pr	SEt	CF ₃
1-334	OCH ₂ c-Pr	SOEt	CF ₃
1-335	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	CF ₃
1-336	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
1-337	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
1-338	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
1-339	OCH ₂ c-Pr	SMe	Cl
1-340	OCH ₂ c-Pr	SOME	Cl
1-341	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	Cl
1-342	OCH ₂ c-Pr	SEt	Cl
1-343	OCH ₂ c-Pr	SOEt	Cl
1-344	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	Cl
1-345	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-346	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-347	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
1-348	OCH ₂ c-Pr	SMe	SO ₂ Me
1-349	OCH ₂ c-Pr	SOME	SO ₂ Me
1-350	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	SO ₂ Me
1-351	OCH ₂ c-Pr	SEt	SO ₂ Me
1-352	OCH ₂ c-Pr	SOEt	SO ₂ Me
1-353	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	SO ₂ Me
1-354	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-355	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-356	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
1-357	SO ₂ Me	F	CF ₃
1-358	SO ₂ Me	NH ₂	CF ₃
1-359	SO ₂ Me	NHEt	Cl
1-360	SMe	SEt	F
1-361	SMe	SMe	F

表2：AがC Yであり、BがC Hであり、Rがエチルである本発明による一般式(I)
の化合物

【0035】

【化3】



【0036】

10

20

30

40

【表2】

No.	X	Y	Z
2-1	F	H	Cl
2-2	F	H	Br
2-3	F	H	SO ₂ Me
2-4	F	H	SO ₂ Et
2-5	F	H	CF ₃
2-6	F	H	NO ₂
2-7	Cl	H	F
2-8	Cl	H	Cl
2-9	Cl	H	Br
2-10	Cl	H	SMe
2-11	Cl	H	SOMe
2-12	Cl	H	SO ₂ Me
2-13	Cl	H	SO ₂ CH ₂ Cl
2-14	Cl	H	SEt
2-15	Cl	H	SO ₂ Et
2-16	Cl	H	CF ₃
2-17	Cl	H	NO ₂
2-18	Cl	H	ピラゾール-1-イル
2-19	Cl	H	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
2-20	Br	H	Cl
2-21	Br	H	Br
2-22	Br	H	SO ₂ Me
2-23	Br	H	SO ₂ Et
2-24	Br	H	CF ₃
2-25	SO ₂ Me	H	Cl
2-26	SO ₂ Me	H	Br
2-27	SO ₂ Me	H	SMe
2-28	SO ₂ Me	H	SOMe
2-29	SO ₂ Me	H	SO ₂ Me
2-30	SO ₂ Me	H	SO ₂ Et
2-31	SO ₂ Me	H	CF ₃
2-32	SO ₂ Et	H	Cl
2-33	SO ₂ Et	H	Br
2-34	SO ₂ Et	H	SMe
2-35	SO ₂ Et	H	SOMe

10

20

30

No.	X	Y	Z
2-36	SO ₂ Et	H	SO ₂ Me
2-37	SO ₂ Et	H	CF ₃
2-38	NO ₂	H	F
2-39	NO ₂	H	Cl
2-40	NO ₂	H	Br
2-41	NO ₂	H	I
2-42	NO ₂	H	CN
2-43	NO ₂	H	SO ₂ Me
2-44	NO ₂	H	SO ₂ Et
2-45	NO ₂	H	CF ₃
2-46	Me	H	Cl
2-47	Me	H	Br
2-48	Me	H	SMe
2-49	Me	H	SO ₂ Me
2-50	Me	H	SO ₂ CH ₂ Cl
2-51	Me	H	SEt
2-52	Me	H	SO ₂ Et
2-53	Me	H	CF ₃
2-54	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃
2-55	Et	H	Cl
2-56	Et	H	Br
2-57	Et	H	SMe
2-58	Et	H	SO ₂ Me
2-59	Et	H	SO ₂ CH ₂ Cl
2-60	Et	H	SEt
2-61	Et	H	SO ₂ Et
2-62	Et	H	CF ₃
2-63	CF ₃	H	Cl
2-64	CF ₃	H	Br
2-65	CF ₃	H	SO ₂ Me
2-66	CF ₃	H	SO ₂ Et
2-67	CF ₃	H	CF ₃
2-68	NO ₂	NH ₂	F
2-69	NO ₂	NHMe	F
2-70	NO ₂	NMe ₂	F
2-71	NO ₂	Me	Cl
2-72	NO ₂	NH ₂	Cl
2-73	NO ₂	NHMe	Cl
2-74	NO ₂	NMe ₂	Cl
2-75	NO ₂	NH ₂	Br
2-76	NO ₂	NHMe	Br
2-77	NO ₂	NMe ₂	Br
2-78	NO ₂	NH ₂	CF ₃
2-79	NO ₂	NMe ₂	CF ₃
2-80	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Me
2-81	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Et
2-82	NO ₂	NHMe	SO ₂ Me
2-83	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
2-84	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Et
2-85	NO ₂	NH ₂	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
2-86	NO ₂	NHMe	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
2-87	NO ₂	NMe ₂	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
2-88	Me	SMe	H
2-89	Me	SOMe	H
2-90	Me	SO ₂ Me	H
2-91	Me	SEt	H
2-92	Me	SOEt	H
2-93	Me	SO ₂ Et	H
2-94	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	H
2-95	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	H
2-96	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	H
2-97	Me	F	F
2-98	Me	F	Cl
2-99	Me	SEt	F
2-100	Me	SOEt	F
2-101	Me	SO ₂ Et	F
2-102	Me	Me	Cl
2-103	Me	F	Cl
2-104	Me	Cl	Cl
2-105	Me	NH ₂	Cl
2-106	Me	NHMe	Cl
2-107	Me	NMe ₂	Cl
2-108	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
2-109	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
2-110	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	Cl
2-111	Me	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
2-112	Me	O(CH ₂) ₂ -CO-NMe ₂	Cl
2-113	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂	Cl
2-114	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NHCO ₂ Et	Cl
2-115	Me	O(CH ₂) ₂ -NHCO ₂ Me	Cl
2-116	Me	O-CH ₂ -NHSO ₂ cPr	Cl
2-117	Me	O(CH ₂)-5-2,4-ジメチル-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン	Cl
2-118	Me	O(CH ₂)-3,5-ジメチル-1,2-オキサゾール-4-イル	Cl
2-119	Me	SMe	Cl
2-120	Me	SOMe	Cl
2-121	Me	SO ₂ Me	Cl
2-122	Me	SEt	Cl
2-123	Me	SOEt	Cl
2-124	Me	SO ₂ Et	Cl
2-125	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
2-126	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
2-127	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
2-128	Me	NH ₂	Br
2-129	Me	NHMe	Br
2-130	Me	NMe ₂	Br
2-131	Me	O(CH ₂)CONEt ₂	Br
2-132	Me	O(CH ₂)-5-ピロリジン-2-オ ン	Br
2-133	Me	SMe	Br
2-134	Me	SOME	Br
2-135	Me	SO ₂ Me	Br
2-136	Me	SEt	Br
2-137	Me	SOEt	Br
2-138	Me	SO ₂ Et	Br
2-139	Me	SMe	I
2-140	Me	SOME	I
2-141	Me	SO ₂ Me	I
2-142	Me	SEt	I
2-143	Me	SOEt	I
2-144	Me	SO ₂ Et	I
2-145	Me	Cl	CF ₃
2-146	Me	SMe	CF ₃
2-147	Me	SOME	CF ₃
2-148	Me	SO ₂ Me	CF ₃
2-149	Me	SEt	CF ₃
2-150	Me	SOEt	CF ₃
2-151	Me	SO ₂ Et	CF ₃
2-152	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
2-153	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
2-154	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
2-155	Me	Me	SO ₂ Me
2-156	Me	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾ ール-3-イル	SO ₂ Me
2-157	Me	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾ ール-3-イル	SO ₂ Et
2-158	Me	5-シアノメチル-4,5-ジヒド ロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
2-159	Me	5-シアノメチル-4,5-ジヒド ロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
2-160	Me	NH ₂	SO ₂ Me
2-161	Me	NHMe	SO ₂ Me
2-162	Me	NMe ₂	SO ₂ Me
2-163	Me	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
2-164	Me	ピラゾール-1-イル	SO ₂ Me
2-165	Me	OH	SO ₂ Me
2-166	Me	OMe	SO ₂ Me
2-167	Me	OMe	SO ₂ Et
2-168	Me	OEt	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
2-169	Me	OEt	SO ₂ Et
2-170	Me	OiPr	SO ₂ Me
2-171	Me	OiPr	SO ₂ Et
2-172	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
2-173	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
2-174	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
2-175	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
2-176	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
2-177	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
2-178	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Me
2-179	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Et
2-180	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
2-181	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
2-182	Me	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Me
2-183	Me	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Et
2-184	Me	O(CH ₂) ₂ -O(3,5-ジメトキシピリミジン-2-イル	SO ₂ Me
2-185	Me	Cl	SO ₂ Me
2-186	Me	SMe	SO ₂ Me
2-187	Me	SOMe	SO ₂ Me
2-188	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
2-189	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Et
2-190	Me	SEt	SO ₂ Me
2-191	Me	SOEt	SO ₂ Me
2-192	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me
2-193	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
2-194	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
2-195	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
2-196	CH ₂ SMe	OMe	SO ₂ Me
2-197	CH ₂ OMe	OMe	SO ₂ Me
2-198	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OME	NH(CH ₂) ₂ OEt	SO ₂ Me
2-199	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OME	NH(CH ₂) ₃ OEt	SO ₂ Me
2-200	CH ₂ O(CH ₂) ₃ OME	OMe	SO ₂ Me
2-201	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OME	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
2-202	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OME	NH(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
2-203	Et	SMe	Cl
2-204	Et	SO ₂ Me	Cl
2-205	Et	SMe	CF ₃
2-206	Et	SO ₂ Me	CF ₃
2-207	Et	F	SO ₂ Me
2-208	Et	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
2-209	iPr	SO ₂ Me	CF ₃
2-210	cPr	SO ₂ Me	CF ₃
2-211	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	F
2-212	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	F
2-213	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	F
2-214	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メ トキシ	F
2-215	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
2-216	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
2-217	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
2-218	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メ トキシ	Cl
2-219	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Br
2-220	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Br
2-221	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Br
2-222	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メ トキシ	Br
2-223	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	I
2-224	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	I
2-225	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	I
2-226	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メ トキシ	I
2-227	CF ₃	F	SO ₂ Me
2-228	CF ₃	F	SO ₂ Et
2-229	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
2-230	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
2-231	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
2-232	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
2-233	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Me
2-234	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Et
2-235	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メ トキシ	SO ₂ Me
2-236	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メ トキシ	SO ₂ Et
2-237	F	SMe	CF ₃
2-238	F	SOMe	CF ₃
2-239	Cl	Me	Cl
2-240	Cl	OCH ₂ CHCH ₂	Cl
2-241	Cl	OCH ₂ CHF ₂	Cl
2-242	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
2-243	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	Cl
2-244	Cl	O(CH ₂)-5-ピロリジン-2-オ ン	Cl
2-245	Cl	SMe	Cl
2-246	Cl	SOMe	Cl
2-247	Cl	SO ₂ Me	Cl
2-248	Cl	F	SMe
2-249	Cl	Cl	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
2-250	Cl	COOMe	SO ₂ Me
2-251	Cl	CONMe ₂	SO ₂ Me
2-252	Cl	CONMe(OMe)	SO ₂ Me
2-253	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me
2-254	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Et
2-255	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Me
2-256	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Et
2-257	Cl	CH ₂ OCH ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
2-258	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
2-259	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et
2-260	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
2-261	Cl	CH ₂ Oc-ペンチル	SO ₂ Me
2-262	Cl	CH ₂ PO(OMe) ₂	SO ₂ Me
2-263	Cl	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SMe
2-264	Cl	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
2-265	Cl	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
2-266	Cl	5-シアノメチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
2-267	Cl	5-シアノメチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
2-268	Cl	5-(メトキシメチル)-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
2-269	Cl	5-(メトキシメチル)-5-メチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
2-270	Cl	CH ₂ O-テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Me
2-271	Cl	CH ₂ O-テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Et
2-272	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-2-イル	SO ₂ Me
2-273	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-2-イル	SO ₂ Et
2-274	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Me
2-275	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Et
2-276	Cl	OMe	SO ₂ Me
2-277	Cl	OMe	SO ₂ Et
2-278	Cl	OEt	SO ₂ Me
2-279	Cl	OEt	SO ₂ Et
2-280	Cl	OiPr	SO ₂ Me
2-281	Cl	OiPr	SO ₂ Et
2-282	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
2-283	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
2-284	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
2-285	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
2-286	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
2-287	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
2-288	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
2-289	Cl	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Me
2-290	Cl	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Et
2-291	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
2-292	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
2-293	Cl	SMe	SO ₂ Me
2-294	Cl	SOMe	SO ₂ Me
2-295	Br	OMe	Br
2-296	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	Br
2-297	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
2-298	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
2-299	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
2-300	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
2-301	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
2-302	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
2-303	Br	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Me
2-304	Br	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Et
2-305	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
2-306	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
2-307	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
2-308	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
2-309	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
2-310	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
2-311	I	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Me
2-312	I	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Et
2-313	OMe	SMe	CF ₃
2-314	OMe	SOMe	CF ₃
2-315	OMe	SO ₂ Me	CF ₃
2-316	OMe	SOEt	CF ₃
2-317	OMe	SO ₂ Et	CF ₃
2-318	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
2-319	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
2-320	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
2-321	OMe	SMe	Cl
2-322	OMe	SOMe	Cl
2-323	OMe	SO ₂ Me	Cl
2-324	OMe	SEt	Cl

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
2-325	OMe	SOEt	Cl
2-326	OMe	SO ₂ Et	Cl
2-327	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
2-328	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
2-329	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
2-330	OCH ₂ c-Pr	SMe	CF ₃
2-331	OCH ₂ c-Pr	SOME	CF ₃
2-332	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	CF ₃
2-333	OCH ₂ c-Pr	SEt	CF ₃
2-334	OCH ₂ c-Pr	SOEt	CF ₃
2-335	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	CF ₃
2-336	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
2-337	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
2-338	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
2-339	OCH ₂ c-Pr	SMe	Cl
2-340	OCH ₂ c-Pr	SOME	Cl
2-341	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	Cl
2-342	OCH ₂ c-Pr	SEt	Cl
2-343	OCH ₂ c-Pr	SOEt	Cl
2-344	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	Cl
2-345	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
2-346	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
2-347	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
2-348	OCH ₂ c-Pr	SMe	SO ₂ Me
2-349	OCH ₂ c-Pr	SOME	SO ₂ Me
2-350	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	SO ₂ Me
2-351	OCH ₂ c-Pr	SEt	SO ₂ Me
2-352	OCH ₂ c-Pr	SOEt	SO ₂ Me
2-353	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	SO ₂ Me
2-354	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
2-355	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
2-356	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
2-357	SO ₂ Me	F	CF ₃
2-358	SO ₂ Me	NH ₂	CF ₃
2-359	SO ₂ Me	NHEt	Cl
2-360	SMe	SEt	F
2-361	SMe	SMe	F

10

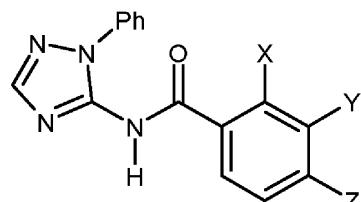
20

30

表3：AがC Yであり、BがC Hであり、Rがフェニルである本発明による一般式(I)の化合物

【0037】

【化4】



【0038】

40

50

【表3】

No.	X	Y	Z
3-1	F	H	Cl
3-2	F	H	Br
3-3	F	H	SO ₂ Me
3-4	F	H	SO ₂ Et
3-5	F	H	CF ₃
3-6	F	H	NO ₂
3-7	Cl	H	F
3-8	Cl	H	Cl
3-9	Cl	H	Br
3-10	Cl	H	SMe
3-11	Cl	H	SOMe
3-12	Cl	H	SO ₂ Me
3-13	Cl	H	SO ₂ CH ₂ Cl
3-14	Cl	H	SEt
3-15	Cl	H	SO ₂ Et
3-16	Cl	H	CF ₃
3-17	Cl	H	NO ₂
3-18	Cl	H	ピラゾール-1-イル
3-19	Cl	H	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
3-20	Br	H	Cl
3-21	Br	H	Br
3-22	Br	H	SO ₂ Me
3-23	Br	H	SO ₂ Et
3-24	Br	H	CF ₃
3-25	SO ₂ Me	H	Cl
3-26	SO ₂ Me	H	Br
3-27	SO ₂ Me	H	SMe
3-28	SO ₂ Me	H	SOMe
3-29	SO ₂ Me	H	SO ₂ Me
3-30	SO ₂ Me	H	SO ₂ Et
3-31	SO ₂ Me	H	CF ₃
3-32	SO ₂ Et	H	Cl
3-33	SO ₂ Et	H	Br
3-34	SO ₂ Et	H	SMe
3-35	SO ₂ Et	H	SOMe

10

20

30

No.	X	Y	Z
3-36	SO ₂ Et	H	SO ₂ Me
3-37	SO ₂ Et	H	CF ₃
3-38	NO ₂	H	F
3-39	NO ₂	H	Cl
3-40	NO ₂	H	Br
3-41	NO ₂	H	I
3-42	NO ₂	H	CN
3-43	NO ₂	H	SO ₂ Me
3-44	NO ₂	H	SO ₂ Et
3-45	NO ₂	H	CF ₃
3-46	Me	H	Cl
3-47	Me	H	Br
3-48	Me	H	SMe
3-49	Me	H	SO ₂ Me
3-50	Me	H	SO ₂ CH ₂ Cl
3-51	Me	H	SEt
3-52	Me	H	SO ₂ Et
3-53	Me	H	CF ₃
3-54	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃
3-55	Et	H	Cl
3-56	Et	H	Br
3-57	Et	H	SMe
3-58	Et	H	SO ₂ Me
3-59	Et	H	SO ₂ CH ₂ Cl
3-60	Et	H	SEt
3-61	Et	H	SO ₂ Et
3-62	Et	H	CF ₃
3-63	CF ₃	H	Cl
3-64	CF ₃	H	Br
3-65	CF ₃	H	SO ₂ Me
3-66	CF ₃	H	SO ₂ Et
3-67	CF ₃	H	CF ₃
3-68	NO ₂	NH ₂	F
3-69	NO ₂	NHMe	F
3-70	NO ₂	NMe ₂	F
3-71	NO ₂	Me	Cl
3-72	NO ₂	NH ₂	Cl
3-73	NO ₂	NHMe	Cl
3-74	NO ₂	NMe ₂	Cl
3-75	NO ₂	NH ₂	Br
3-76	NO ₂	NHMe	Br
3-77	NO ₂	NMe ₂	Br
3-78	NO ₂	NH ₂	CF ₃
3-79	NO ₂	NMe ₂	CF ₃
3-80	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Me
3-81	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Et
3-82	NO ₂	NHMe	SO ₂ Me
3-83	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
3-84	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Et
3-85	NO ₂	NH ₂	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
3-86	NO ₂	NHMe	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
3-87	NO ₂	NMe ₂	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
3-88	Me	SMe	H
3-89	Me	SOMe	H
3-90	Me	SO ₂ Me	H
3-91	Me	SEt	H
3-92	Me	SOEt	H
3-93	Me	SO ₂ Et	H
3-94	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	H
3-95	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	H
3-96	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	H
3-97	Me	F	F
3-98	Me	F	Cl
3-99	Me	SEt	F
3-100	Me	SOEt	F
3-101	Me	SO ₂ Et	F
3-102	Me	Me	Cl
3-103	Me	F	Cl
3-104	Me	Cl	Cl
3-105	Me	NH ₂	Cl
3-106	Me	NHMe	Cl
3-107	Me	NMe ₂	Cl
3-108	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
3-109	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
3-110	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	Cl
3-111	Me	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
3-112	Me	O(CH ₂) ₂ CONMe ₂	Cl
3-113	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂	Cl
3-114	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NHCO ₂ Et	Cl
3-115	Me	O(CH ₂) ₂ NHCO ₂ Me	Cl
3-116	Me	OCH ₂ NHSO ₂ cPr	Cl
3-117	Me	O(CH ₂)-5-2,4-ジメチル-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン	Cl
3-118	Me	O(CH ₂)-3,5-ジメチル-1,2-オキサゾール-4-イル	Cl
3-119	Me	SMe	Cl
3-120	Me	SOMe	Cl
3-121	Me	SO ₂ Me	Cl
3-122	Me	SEt	Cl
3-123	Me	SOEt	Cl
3-124	Me	SO ₂ Et	Cl
3-125	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
3-126	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
3-127	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
3-128	Me	NH ₂	Br
3-129	Me	NHMe	Br
3-130	Me	NMe ₂	Br
3-131	Me	OCH ₂ CONMe ₂	Br
3-132	Me	O(CH ₂)-5-ピロリジン-2-オ ン	Br
3-133	Me	SMe	Br
3-134	Me	SOMe	Br
3-135	Me	SO ₂ Me	Br
3-136	Me	SEt	Br
3-137	Me	SOEt	Br
3-138	Me	SO ₂ Et	Br
3-139	Me	SMe	I
3-140	Me	SOMe	I
3-141	Me	SO ₂ Me	I
3-142	Me	SEt	I
3-143	Me	SOEt	I
3-144	Me	SO ₂ Et	I
3-145	Me	Cl	CF ₃
3-146	Me	SMe	CF ₃
3-147	Me	SOMe	CF ₃
3-148	Me	SO ₂ Me	CF ₃
3-149	Me	SEt	CF ₃
3-150	Me	SOEt	CF ₃
3-151	Me	SO ₂ Et	CF ₃
3-152	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
3-153	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
3-154	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
3-155	Me	Me	SO ₂ Me
3-156	Me	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾ ール-3-イル	SO ₂ Me
3-157	Me	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾ ール-3-イル	SO ₂ Et
3-158	Me	5-シアノメチル-4,5-ジヒド ロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
3-159	Me	5-シアノメチル-4,5-ジヒド ロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
3-160	Me	NH ₂	SO ₂ Me
3-161	Me	NHMe	SO ₂ Me
3-162	Me	NMe ₂	SO ₂ Me
3-163	Me	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-164	Me	ピラゾール-1-イル	SO ₂ Me
3-165	Me	OH	SO ₂ Me
3-166	Me	OMe	SO ₂ Me
3-167	Me	OMe	SO ₂ Et
3-168	Me	OEt	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
3-169	Me	OEt	SO ₂ Et
3-170	Me	OiPr	SO ₂ Me
3-171	Me	OiPr	SO ₂ Et
3-172	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-173	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
3-174	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
3-175	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
3-176	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
3-177	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
3-178	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Me
3-179	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Et
3-180	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
3-181	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
3-182	Me	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Me
3-183	Me	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Et
3-184	Me	O(CH ₂) ₂ -O(3,5-ジメトキシピリミジン-2-イル	SO ₂ Me
3-185	Me	Cl	SO ₂ Me
3-186	Me	SMe	SO ₂ Me
3-187	Me	SOMe	SO ₂ Me
3-188	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
3-189	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Et
3-190	Me	SEt	SO ₂ Me
3-191	Me	SOEt	SO ₂ Me
3-192	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me
3-193	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-194	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-195	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-196	CH ₂ SMe	OMe	SO ₂ Me
3-197	CH ₂ OMe	OMe	SO ₂ Me
3-198	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OEt	SO ₂ Me
3-199	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OEt	SO ₂ Me
3-200	CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe	OMe	SO ₂ Me
3-201	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-202	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
3-203	Et	SMe	Cl
3-204	Et	SO ₂ Me	Cl
3-205	Et	SMe	CF ₃
3-206	Et	SO ₂ Me	CF ₃
3-207	Et	F	SO ₂ Me
3-208	Et	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-209	iPr	SO ₂ Me	CF ₃
3-210	cPr	SO ₂ Me	CF ₃
3-211	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	F
3-212	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	F
3-213	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	F

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
3-214	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	F
3-215	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
3-216	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
3-217	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
3-218	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	Cl
3-219	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Br
3-220	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Br
3-221	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Br
3-222	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	Br
3-223	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	I
3-224	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	I
3-225	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	I
3-226	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	I
3-227	CF ₃	F	SO ₂ Me
3-228	CF ₃	F	SO ₂ Et
3-229	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-230	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
3-231	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
3-232	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
3-233	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Me
3-234	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Et
3-235	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Me
3-236	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Et
3-237	F	SMe	CF ₃
3-238	F	SOMe	CF ₃
3-239	Cl	Me	Cl
3-240	Cl	OCH ₂ CHCH ₂	Cl
3-241	Cl	OCH ₂ CHF ₂	Cl
3-242	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
3-243	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	Cl
3-244	Cl	O(CH ₂)-5-ピロリジン-2-オ ン	Cl
3-245	Cl	SMe	Cl
3-246	Cl	SOMe	Cl
3-247	Cl	SO ₂ Me	Cl
3-248	Cl	F	SMe
3-249	Cl	Cl	SO ₂ Me
3-250	Cl	COOMe	SO ₂ Me
3-251	Cl	CONMe ₂	SO ₂ Me
3-252	Cl	CONMe(OMe)	SO ₂ Me
3-253	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me
3-254	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Et

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
3-255	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Me
3-256	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Et
3-257	Cl	CH ₂ OCH ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
3-258	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
3-259	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et
3-260	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
3-261	Cl	CH ₂ Oc-ベンチル	SO ₂ Me
3-262	Cl	CH ₂ PO(OMe) ₂	SO ₂ Me
3-263	Cl	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SMe
3-264	Cl	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
3-265	Cl	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
3-266	Cl	5-シアノメチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
3-267	Cl	5-シアノメチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
3-268	Cl	5-(メトキシメチル)-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
3-269	Cl	5-(メトキシメチル)-5-メチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
3-270	Cl	CH ₂ O-テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Me
3-271	Cl	CH ₂ O-テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Et
3-272	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-2-イル	SO ₂ Me
3-273	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-2-イル	SO ₂ Et
3-274	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Me
3-275	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Et
3-276	Cl	OMe	SO ₂ Me
3-277	Cl	OMe	SO ₂ Et
3-278	Cl	OEt	SO ₂ Me
3-279	Cl	OEt	SO ₂ Et
3-280	Cl	OiPr	SO ₂ Me
3-281	Cl	OiPr	SO ₂ Et
3-282	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-283	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
3-284	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
3-285	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
3-286	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
3-287	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
3-288	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
3-289	Cl	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Me
3-290	Cl	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Et
3-291	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
3-292	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
3-293	Cl	SMe	SO ₂ Me
3-294	Cl	SOMe	SO ₂ Me
3-295	Br	OMe	Br
3-296	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	Br
3-297	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-298	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
3-299	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
3-300	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
3-301	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
3-302	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
3-303	Br	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Me
3-304	Br	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Et
3-305	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-306	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
3-307	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
3-308	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
3-309	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
3-310	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
3-311	I	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Me
3-312	I	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Et
3-313	OMe	SMe	CF ₃
3-314	OMe	SOMe	CF ₃
3-315	OMe	SO ₂ Me	CF ₃
3-316	OMe	SOEt	CF ₃
3-317	OMe	SO ₂ Et	CF ₃
3-318	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
3-319	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
3-320	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
3-321	OMe	SMe	Cl
3-322	OMe	SOMe	Cl
3-323	OMe	SO ₂ Me	Cl
3-324	OMe	SEt	Cl
3-325	OMe	SOEt	Cl
3-326	OMe	SO ₂ Et	Cl
3-327	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
3-328	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
3-329	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl

10

20

30

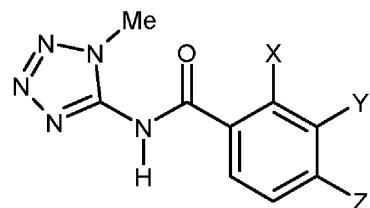
40

No.	X	Y	Z
3-330	OCH ₂ c-Pr	SMe	CF ₃
3-331	OCH ₂ c-Pr	SOMe	CF ₃
3-332	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	CF ₃
3-333	OCH ₂ c-Pr	SEt	CF ₃
3-334	OCH ₂ c-Pr	SOEt	CF ₃
3-335	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	CF ₃
3-336	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
3-337	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
3-338	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
3-339	OCH ₂ c-Pr	SMe	Cl
3-340	OCH ₂ c-Pr	SOMe	Cl
3-341	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	Cl
3-342	OCH ₂ c-Pr	SEt	Cl
3-343	OCH ₂ c-Pr	SOEt	Cl
3-344	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	Cl
3-345	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
3-346	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
3-347	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
3-348	OCH ₂ c-Pr	SMe	SO ₂ Me
3-349	OCH ₂ c-Pr	SOMe	SO ₂ Me
3-350	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	SO ₂ Me
3-351	OCH ₂ c-Pr	SEt	SO ₂ Me
3-352	OCH ₂ c-Pr	SOEt	SO ₂ Me
3-353	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	SO ₂ Me
3-354	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-355	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-356	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
3-357	SO ₂ Me	F	CF ₃
3-358	SO ₂ Me	NH ₂	CF ₃
3-359	SO ₂ Me	NHEt	Cl
3-360	SMe	SEt	F
3-361	SMe	SMe	F

表4：AがC Yであり、BがNであり、Rがメチルである本発明による一般式（I）の化合物

【0039】

【化5】



【0040】

10

20

30

40

【表4】

No.	X	Y	Z
4-1	F	H	Cl
4-2	F	H	Br
4-3	F	H	SO ₂ Me
4-4	F	H	SO ₂ Et
4-5	F	H	CF ₃
4-6	Cl	H	F
4-7	Cl	H	Cl
4-8	Cl	H	Br
4-9	Cl	H	SMe
4-10	Cl	H	SO ₂ Me
4-11	Cl	H	SO ₂ CH ₂ Cl
4-12	Cl	H	SEt
4-13	Cl	H	SO ₂ Et
4-14	Cl	H	CF ₃
4-15	Br	H	Cl
4-16	Br	H	Br
4-17	Br	H	SO ₂ Me
4-18	Br	H	SO ₂ Et
4-19	Br	H	CF ₃
4-20	SO ₂ Me	H	Cl
4-21	SO ₂ Me	H	Br
4-22	SO ₂ Me	H	SMe
4-23	SO ₂ Me	H	SOMe
4-24	SO ₂ Me	H	SO ₂ Me
4-25	SO ₂ Me	H	CF ₃
4-26	SO ₂ Et	H	Cl
4-27	SO ₂ Et	H	Br
4-28	SO ₂ Et	H	SMe
4-29	SO ₂ Et	H	SOMe
4-30	SO ₂ Et	H	SO ₂ Me
4-31	SO ₂ Et	H	CF ₃
4-32	NO ₂	H	F
4-33	NO ₂	H	Cl
4-34	NO ₂	H	Br
4-35	NO ₂	H	I
4-36	NO ₂	H	CN

10

20

30

No.	X	Y	Z
4-37	NO ₂	H	SO ₂ Me
4-38	NO ₂	H	SO ₂ Et
4-39	NO ₂	H	CF ₃
4-40	Me	H	Cl
4-41	Me	H	Br
4-42	Me	H	SO ₂ Me
4-43	Me	H	SO ₂ CH ₂ Cl
4-44	Me	H	SO ₂ Et
4-45	Me	H	CF ₃
4-46	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃
4-47	Et	H	Cl
4-48	Et	H	Br
4-49	Et	H	SO ₂ Me
4-50	Et	H	SO ₂ CH ₂ Cl
4-51	Et	H	SEt
4-52	Et	H	SO ₂ Et
4-53	Et	H	CF ₃
4-54	CF ₃	H	Cl
4-55	CF ₃	H	Br
4-56	CF ₃	H	SO ₂ Me
4-57	CF ₃	H	CF ₃
4-58	NO ₂	NH ₂	F
4-59	NO ₂	NHMe	F
4-60	NO ₂	NMe ₂	F
4-61	NO ₂	Me	Cl
4-62	NO ₂	NH ₂	Cl
4-63	NO ₂	NHMe	Cl
4-64	NO ₂	NMe ₂	Cl
4-65	NO ₂	NH ₂	Br
4-66	NO ₂	NHMe	Br
4-67	NO ₂	NMe ₂	Br
4-68	NO ₂	NH ₂	CF ₃
4-69	NO ₂	NMe ₂	CF ₃
4-70	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Me
4-71	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Et
4-72	NO ₂	NHMe	SO ₂ Me
4-73	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Me
4-74	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Et
4-75	NO ₂	NH ₂	1H-1,2,4- トリアゾール -1-イル
4-76	NO ₂	NHMe	1H-1,2,4- トリアゾール -1-イル
4-77	NO ₂	NMe ₂	1H-1,2,4- トリアゾール -1-イル
4-78	Me	SMe	H
4-79	Me	SOMe	H
4-80	Me	SO ₂ Me	H
4-81	Me	SEt	H

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
4-82	Me	SOEt	H
4-83	Me	SO ₂ Et	H
4-84	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	H
4-85	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	H
4-86	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	H
4-87	Me	F	F
4-88	Me	SEt	F
4-89	Me	SOEt	F
4-90	Me	SO ₂ Et	F
4-91	Me	Me	Cl
4-92	Me	F	Cl
4-93	Me	Cl	Cl
4-94	Me	NH ₂	Cl
4-95	Me	NHMe	Cl
4-96	Me	NMe ₂	Cl
4-97	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-98	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
4-99	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	Cl
4-100	Me	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
4-101	Me	O(CH ₂) ₂ CONMe ₂	Cl
4-102	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂	Cl
4-103	Me	O(CH ₂) ₂ NH(CO)NHCO ₂ Et	Cl
4-104	Me	O(CH ₂) ₂ NHCO ₂ Me	Cl
4-105	Me	OCH ₂ NHSO ₂ cPr	Cl
4-106	Me	O(CH ₂) ₅ -2,4-ジメチル -2,4-ジヒドロ)-3H-1,2,4-ト リアゾール-3-オン	Cl
4-107	Me	O(CH ₂) ₃ ,5-ジメチル-1,2-オ キサゾール-4-イル	Cl
4-108	Me	SMe	Cl
4-109	Me	SOMe	Cl
4-110	Me	SO ₂ Me	Cl
4-111	Me	SEt	Cl
4-112	Me	SOEt	Cl
4-113	Me	SO ₂ Et	Cl
4-114	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-115	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-116	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-117	Me	NH ₂	Br
4-118	Me	NHMe	Br
4-119	Me	NMe ₂	Br
4-120	Me	OCH ₂ CONEt ₂	Br
4-121	Me	O(CH ₂) ₅ -ピロリジン-2-オ ン	Br
4-122	Me	SMe	Br
4-123	Me	SOMe	Br
4-124	Me	SO ₂ Me	Br
4-125	Me	SEt	Br

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
4-126	Me	SOEt	Br
4-127	Me	SO ₂ Et	Br
4-128	Me	SMe	I
4-129	Me	SOMe	I
4-130	Me	SO ₂ Me	I
4-131	Me	SEt	I
4-132	Me	SOEt	I
4-133	Me	SO ₂ Et	I
4-134	Me	Cl	CF ₃
4-135	Me	SMe	CF ₃
4-136	Me	SOMe	CF ₃
4-137	Me	SO ₂ Me	CF ₃
4-138	Me	SEt	CF ₃
4-139	Me	SOEt	CF ₃
4-140	Me	SO ₂ Et	CF ₃
4-141	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
4-142	Me	S(O)(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
4-143	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
4-144	Me	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
4-145	Me	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
4-146	Me	5-シアノメチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
4-147	Me	5-シアノメチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
4-148	Me	NH ₂	SO ₂ Me
4-149	Me	NHMe	SO ₂ Me
4-150	Me	NMe ₂	SO ₂ Me
4-151	Me	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-152	Me	ピラゾール-1-イル	SO ₂ Me
4-153	Me	OH	SO ₂ Me
4-154	Me	OMe	SO ₂ Me
4-155	Me	OMe	SO ₂ Et
4-156	Me	OEt	SO ₂ Me
4-157	Me	OEt	SO ₂ Et
4-158	Me	OiPr	SO ₂ Me
4-159	Me	OiPr	SO ₂ Et
4-160	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-161	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
4-162	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
4-163	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
4-164	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
4-165	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
4-166	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Me
4-167	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Et
4-168	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
4-169	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
4-170	Me	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Me
4-171	Me	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Et
4-172	Me	O(CH ₂) ₂ -O(3,5-ジメトキシピリミジン-2-イル)	SO ₂ Me
4-173	Me	Cl	SO ₂ Me
4-174	Me	SMe	SO ₂ Me
4-175	Me	SOMe	SO ₂ Me
4-176	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
4-177	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Et
4-178	Me	SEt	SO ₂ Me
4-179	Me	SOEt	SO ₂ Me
4-180	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me
4-181	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-182	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-183	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-184	CH ₂ SM _e	OMe	SO ₂ Me
4-185	CH ₂ OMe	OMe	SO ₂ Me
4-186	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OEt	SO ₂ Me
4-187	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OEt	SO ₂ Me
4-188	CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe	OMe	SO ₂ Me
4-189	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-190	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
4-191	Et	SMe	Cl
4-192	Et	SO ₂ Me	Cl
4-193	Et	SMe	CF ₃
4-194	Et	SO ₂ Me	CF ₃
4-195	Et	F	SO ₂ Me
4-196	Et	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-197	iPr	SMe	CF ₃
4-198	iPr	SO ₂ Me	CF ₃
4-199	cPr	SO ₂ Me	CF ₃
4-200	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	F
4-201	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	F
4-202	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	F
4-203	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	F
4-204	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-205	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
4-206	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
4-207	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	Cl
4-208	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Br
4-209	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Br
4-210	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Br
4-211	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Br
4-212	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	Br

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
		トキシ	
4-213	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	I
4-214	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	I
4-215	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	I
4-216	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メ トキシ	I
4-217	CF ₃	F	SO ₂ Me
4-218	CF ₃	F	SO ₂ Et
4-219	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-220	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
4-221	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
4-222	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
4-223	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Me
4-224	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Et
4-225	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メ トキシ	SO ₂ Me
4-226	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メ トキシ	SO ₂ Et
4-227	F	SMe	CF ₃
4-228	F	SOMe	CF ₃
4-229	Cl	SMe	H
4-230	Cl	SOMe	H
4-231	Cl	SO ₂ Me	H
4-232	Cl	SEt	H
4-233	Cl	SOEt	H
4-234	Cl	SO ₂ Et	H
4-235	Cl	S(CH ₂) ₂ OMe	H
4-236	Cl	SO(CH ₂) ₂ OMe	H
4-237	Cl	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	H
4-238	Cl	Me	Cl
4-239	Cl	Cl	Cl
4-240	Cl	OCH ₂ CHCH ₂	Cl
4-241	Cl	OCH ₂ CHF ₂	Cl
4-242	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-243	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	Cl
4-244	Cl	O(CH ₂)-5-ピロリジン-2-オ ン	Cl
4-245	Cl	SMe	Cl
4-246	Cl	SOMe	Cl
4-247	Cl	SO ₂ Me	Cl
4-248	Cl	F	SMe
4-249	Cl	Cl	SO ₂ Me
4-250	Cl	COOMe	SO ₂ Me
4-251	Cl	CONMe ₂	SO ₂ Me
4-252	Cl	CONMe(OMe)	SO ₂ Me
4-253	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me
4-254	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Et
4-255	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
4-256	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Et
4-257	Cl	CH ₂ OiPr	SO ₂ Me
4-258	Cl	CH ₂ Oc-ペンチル	SO ₂ Me
4-259	Cl	CH ₂ OCH ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
4-260	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
4-261	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et
4-262	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
4-263	Cl	CH ₂ PO ₃ Me ₂	SO ₂ Me
4-264	Cl	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SMe
4-265	Cl	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
4-266	Cl	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
4-267	Cl	5-シアノメチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
4-268	Cl	5-シアノメチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
4-269	Cl	CH ₂ O-テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Me
4-270	Cl	CH ₂ O-テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Et
4-271	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-2-イル	SO ₂ Me
4-272	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-2-イル	SO ₂ Et
4-273	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Me
4-274	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Et
4-275	Cl	ピラゾール-1-イル	SO ₂ Me
4-276	Cl	OMe	SO ₂ Me
4-277	Cl	OMe	SO ₂ Et
4-278	Cl	OEt	SO ₂ Me
4-279	Cl	OEt	SO ₂ Et
4-280	Cl	OiPr	SO ₂ Me
4-281	Cl	OiPr	SO ₂ Et
4-282	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-283	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
4-284	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
4-285	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
4-286	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
4-287	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
4-288	Cl	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Me
4-289	Cl	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Et
4-290	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
4-291	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
4-292	Cl	SMe	SO ₂ Me
4-293	Cl	SOMe	SO ₂ Me
4-294	Br	OMe	Br
4-295	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	Br
4-296	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-297	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
4-298	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
4-299	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
4-300	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
4-301	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
4-302	Br	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Me
4-303	Br	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Et
4-304	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-305	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
4-306	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
4-307	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
4-308	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
4-309	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
4-310	I	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Me
4-311	I	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Et
4-312	OMe	SMe	CF ₃
4-313	OMe	SOMe	CF ₃
4-314	OMe	SO ₂ Me	CF ₃
4-315	OMe	SEt	CF ₃
4-316	OMe	SOEt	CF ₃
4-317	OMe	SO ₂ Et	CF ₃
4-318	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
4-319	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
4-320	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
4-321	OMe	SMe	Cl
4-322	OMe	SOMe	Cl
4-323	OMe	SO ₂ Me	Cl
4-324	OMe	SEt	Cl
4-325	OMe	SOEt	Cl
4-326	OMe	SO ₂ Et	Cl
4-327	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-328	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-329	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-330	OCH ₂ c-Pr	SMe	CF ₃
4-331	OCH ₂ c-Pr	SOMe	CF ₃
4-332	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	CF ₃
4-333	OCH ₂ c-Pr	SEt	CF ₃
4-334	OCH ₂ c-Pr	SOEt	CF ₃

10

20

30

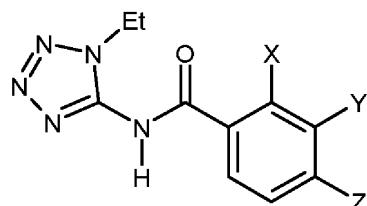
40

No.	X	Y	Z
4-335	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	CF ₃
4-336	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
4-337	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
4-338	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
4-339	OCH ₂ c-Pr	SMe	Cl
4-340	OCH ₂ c-Pr	SOME	Cl
4-341	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	Cl
4-342	OCH ₂ c-Pr	SEt	Cl
4-343	OCH ₂ c-Pr	SOEt	Cl
4-344	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	Cl
4-345	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-346	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-347	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
4-348	OCH ₂ c-Pr	SMe	SO ₂ Me
4-349	OCH ₂ c-Pr	SOME	SO ₂ Me
4-350	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	SO ₂ Me
4-351	OCH ₂ c-Pr	SEt	SO ₂ Me
4-352	OCH ₂ c-Pr	SOEt	SO ₂ Me
4-353	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	SO ₂ Me
4-354	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-355	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-356	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
4-357	SO ₂ Me	F	CF ₃
4-358	SO ₂ Me	NH ₂	CF ₃
4-359	SO ₂ Me	NHEt	Cl
4-360	SMe	SEt	F
4-361	SMe	SMe	F

表 5 : A が C Y であり、 B が N であり、 R がエチルである本発明による一般式 (I) の
化合物

【 0 0 4 1 】

【 化 6 】



【 0 0 4 2 】

10

20

30

【表5】

No.	X	Y	Z
5-1	F	H	Cl
5-2	F	H	Br
5-3	F	H	SO ₂ Me
5-4	F	H	SO ₂ Et
5-5	F	H	CF ₃
5-6	F	H	NO ₂
5-7	Cl	H	F
5-8	Cl	H	Cl
5-9	Cl	H	Br
5-10	Cl	H	SMe
5-11	Cl	H	SOMe
5-12	Cl	H	SO ₂ Me
5-13	Cl	H	SO ₂ CH ₂ Cl
5-14	Cl	H	SEt
5-15	Cl	H	SO ₂ Et
5-16	Cl	H	CF ₃
5-17	Cl	H	NO ₂
5-18	Cl	H	ピラゾール-1-イル
5-19	Cl	H	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
5-20	Br	H	Cl
5-21	Br	H	Br
5-22	Br	H	SO ₂ Me
5-23	Br	H	SO ₂ Et
5-24	Br	H	CF ₃
5-25	SO ₂ Me	H	Cl
5-26	SO ₂ Me	H	Br
5-27	SO ₂ Me	H	SMe
5-28	SO ₂ Me	H	SOMe
5-29	SO ₂ Me	H	SO ₂ Me
5-30	SO ₂ Me	H	SO ₂ Et
5-31	SO ₂ Me	H	CF ₃
5-32	SO ₂ Et	H	Cl
5-33	SO ₂ Et	H	Br
5-34	SO ₂ Et	H	SMe
5-35	SO ₂ Et	H	SOMe

10

20

30

No.	X	Y	Z
5-36	SO ₂ Et	H	SO ₂ Me
5-37	SO ₂ Et	H	CF ₃
5-38	NO ₂	H	F
5-39	NO ₂	H	Cl
5-40	NO ₂	H	Br
5-41	NO ₂	H	I
5-42	NO ₂	H	CN
5-43	NO ₂	H	SO ₂ Me
5-44	NO ₂	H	SO ₂ Et
5-45	NO ₂	H	CF ₃
5-46	Me	H	Cl
5-47	Me	H	Br
5-48	Me	H	SMe
5-49	Me	H	SO ₂ Me
5-50	Me	H	SO ₂ CH ₂ Cl
5-51	Me	H	SEt
5-52	Me	H	SO ₂ Et
5-53	Me	H	CF ₃
5-54	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃
5-55	Et	H	Cl
5-56	Et	H	Br
5-57	Et	H	SMe
5-58	Et	H	SO ₂ Me
5-59	Et	H	SO ₂ CH ₂ Cl
5-60	Et	H	SEt
5-61	Et	H	SO ₂ Et
5-62	Et	H	CF ₃
5-63	CF ₃	H	Cl
5-64	CF ₃	H	Br
5-65	CF ₃	H	SO ₂ Me
5-66	CF ₃	H	SO ₂ Et
5-67	CF ₃	H	CF ₃
5-68	NO ₂	NH ₂	F
5-69	NO ₂	NHMe	F
5-70	NO ₂	NMe ₂	F
5-71	NO ₂	Me	Cl
5-72	NO ₂	NH ₂	Cl
5-73	NO ₂	NHMe	Cl
5-74	NO ₂	NMe ₂	Cl
5-75	NO ₂	NH ₂	Br
5-76	NO ₂	NHMe	Br
5-77	NO ₂	NMe ₂	Br
5-78	NO ₂	NH ₂	CF ₃
5-79	NO ₂	NMe ₂	CF ₃
5-80	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Me
5-81	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Et
5-82	NO ₂	NHMe	SO ₂ Me
5-83	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
5-84	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Et
5-85	NO ₂	NH ₂	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
5-86	NO ₂	NHMe	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
5-87	NO ₂	NMe ₂	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
5-88	Me	SMe	H
5-89	Me	SOMe	H
5-90	Me	SO ₂ Me	H
5-91	Me	SEt	H
5-92	Me	SOEt	H
5-93	Me	SO ₂ Et	H
5-94	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	H
5-95	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	H
5-96	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	H
5-97	Me	F	F
5-98	Me	F	Cl
5-99	Me	SEt	F
5-100	Me	SOEt	F
5-101	Me	SO ₂ Et	F
5-102	Me	Me	Cl
5-103	Me	F	Cl
5-104	Me	Cl	Cl
5-105	Me	NH ₂	Cl
5-106	Me	NHMe	Cl
5-107	Me	NMe ₂	Cl
5-108	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-109	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
5-110	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	Cl
5-111	Me	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
5-112	Me	O(CH ₂) ₂ -CO-NMe ₂	Cl
5-113	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂	Cl
5-114	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NHCO ₂ Et	Cl
5-115	Me	O(CH ₂) ₂ -NHCO ₂ Me	Cl
5-116	Me	O-CH ₂ -NSO ₂ cPr	Cl
5-117	Me	O(CH ₂)-5-2,4-ジメチル-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン	Cl
5-118	Me	O(CH ₂)-3,5-ジメチル-1,2-オキサゾール-4-イル	Cl
5-119	Me	SMe	Cl
5-120	Me	SOMe	Cl
5-121	Me	SO ₂ Me	Cl
5-122	Me	SEt	Cl
5-123	Me	SOEt	Cl
5-124	Me	SO ₂ Et	Cl
5-125	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
5-126	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-127	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-128	Me	NH ₂	Br
5-129	Me	NHMe	Br
5-130	Me	NMe ₂	Br
5-131	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	Br
5-132	Me	O(CH ₂)-5-ピロリジン-2-オ ン	Br
5-133	Me	SMe	Br
5-134	Me	SOMe	Br
5-135	Me	SO ₂ Me	Br
5-136	Me	SEt	Br
5-137	Me	SOEt	Br
5-138	Me	SO ₂ Et	Br
5-139	Me	SMe	I
5-140	Me	SOMe	I
5-141	Me	SO ₂ Me	I
5-142	Me	SEt	I
5-143	Me	SOEt	I
5-144	Me	SO ₂ Et	I
5-145	Me	Cl	CF ₃
5-146	Me	SMe	CF ₃
5-147	Me	SOMe	CF ₃
5-148	Me	SO ₂ Me	CF ₃
5-149	Me	SEt	CF ₃
5-150	Me	SOEt	CF ₃
5-151	Me	SO ₂ Et	CF ₃
5-152	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
5-153	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
5-154	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
5-155	Me	Me	SO ₂ Me
5-156	Me	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾ ール-3-イル	SO ₂ Me
5-157	Me	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾ ール-3-イル	SO ₂ Et
5-158	Me	5-シアノメチル-4,5-ジヒド ロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
5-159	Me	5-シアノメチル-4,5-ジヒド ロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
5-160	Me	NH ₂	SO ₂ Me
5-161	Me	NHMe	SO ₂ Me
5-162	Me	NMe ₂	SO ₂ Me
5-163	Me	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
5-164	Me	ピラゾール-1-イル	SO ₂ Me
5-165	Me	OH	SO ₂ Me
5-166	Me	OMe	SO ₂ Me
5-167	Me	OMe	SO ₂ Et
5-168	Me	OEt	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
5-169	Me	OEt	SO ₂ Et
5-170	Me	OiPr	SO ₂ Me
5-171	Me	OiPr	SO ₂ Et
5-172	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
5-173	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
5-174	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
5-175	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
5-176	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
5-177	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
5-178	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Me
5-179	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Et
5-180	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
5-181	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
5-182	Me	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Me
5-183	Me	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Et
5-184	Me	O(CH ₂) ₂ -O(3,5-ジメトキシピリミジン-2-イル	SO ₂ Me
5-185	Me	Cl	SO ₂ Me
5-186	Me	SMe	SO ₂ Me
5-187	Me	SOMe	SO ₂ Me
5-188	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
5-189	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Et
5-190	Me	SEt	SO ₂ Me
5-191	Me	SOEt	SO ₂ Me
5-192	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me
5-193	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
5-194	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
5-195	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
5-196	CH ₂ SMe	OMe	SO ₂ Me
5-197	CH ₂ OMe	OMe	SO ₂ Me
5-198	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OEt	SO ₂ Me
5-199	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OEt	SO ₂ Me
5-200	CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe	OMe	SO ₂ Me
5-201	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
5-202	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
5-203	Et	SMe	Cl
5-204	Et	SO ₂ Me	Cl
5-205	Et	SMe	CF ₃
5-206	Et	SO ₂ Me	CF ₃
5-207	Et	F	SO ₂ Me
5-208	Et	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
5-209	iPr	SO ₂ Me	CF ₃
5-210	cPr	SO ₂ Me	CF ₃
5-211	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	F
5-212	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	F
5-213	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	F

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
5-214	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	F
5-215	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-216	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
5-217	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
5-218	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	Cl
5-219	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Br
5-220	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Br
5-221	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Br
5-222	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	Br
5-223	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	I
5-224	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	I
5-225	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	I
5-226	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	I
5-227	CF ₃	F	SO ₂ Me
5-228	CF ₃	F	SO ₂ Et
5-229	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
5-230	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
5-231	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
5-232	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
5-233	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Me
5-234	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Et
5-235	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Me
5-236	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Et
5-237	F	SMe	CF ₃
5-238	F	SOMe	CF ₃
5-239	Cl	Me	Cl
5-240	Cl	OCH ₂ CHCH ₂	Cl
5-241	Cl	OCH ₂ CHF ₂	Cl
5-242	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-243	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	Cl
5-244	Cl	O(CH ₂) ₅ -ピロリジン-2-オ ン	Cl
5-245	Cl	SMe	Cl
5-246	Cl	SOMe	Cl
5-247	Cl	SO ₂ Me	Cl
5-248	Cl	F	SMe
5-249	Cl	Cl	SO ₂ Me
5-250	Cl	COOMe	SO ₂ Me
5-251	Cl	CONMe ₂	SO ₂ Me
5-252	Cl	CONMe(OMe)	SO ₂ Me
5-253	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me
5-254	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Et

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
5-255	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Me
5-256	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Et
5-257	Cl	CH ₂ OCH ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
5-258	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
5-259	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et
5-260	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
5-261	Cl	CH ₂ Oc-ペンチル	SO ₂ Me
5-262	Cl	CH ₂ PO(OMe) ₂	SO ₂ Me
5-263	Cl	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SMe
5-264	Cl	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
5-265	Cl	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
5-266	Cl	5-シアノメチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
5-267	Cl	5-シアノメチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
5-268	Cl	5-(メトキシメチル)-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
5-269	Cl	5-(メトキシメチル)-5-メチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
5-270	Cl	CH ₂ O-テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Me
5-271	Cl	CH ₂ O-テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Et
5-272	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-2-イル	SO ₂ Me
5-273	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-2-イル	SO ₂ Et
5-274	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Me
5-275	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Et
5-276	Cl	OMe	SO ₂ Me
5-277	Cl	OMe	SO ₂ Et
5-278	Cl	OEt	SO ₂ Me
5-279	Cl	OEt	SO ₂ Et
5-280	Cl	OiPr	SO ₂ Me
5-281	Cl	OiPr	SO ₂ Et
5-282	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
5-283	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
5-284	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
5-285	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
5-286	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
5-287	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
5-288	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
5-289	Cl	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Me
5-290	Cl	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Et
5-291	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
5-292	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
5-293	Cl	SMe	SO ₂ Me
5-294	Cl	SOMe	SO ₂ Me
5-295	Br	OMe	Br
5-296	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	Br
5-297	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
5-298	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
5-299	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
5-300	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
5-301	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
5-302	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
5-303	Br	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Me
5-304	Br	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Et
5-305	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
5-306	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
5-307	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
5-308	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
5-309	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
5-310	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
5-311	I	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Me
5-312	I	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Et
5-313	OMe	SMe	CF ₃
5-314	OMe	SOMe	CF ₃
5-315	OMe	SO ₂ Me	CF ₃
5-316	OMe	SOEt	CF ₃
5-317	OMe	SO ₂ Et	CF ₃
5-318	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
5-319	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
5-320	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
5-321	OMe	SMe	Cl
5-322	OMe	SOMe	Cl
5-323	OMe	SO ₂ Me	Cl
5-324	OMe	SEt	Cl
5-325	OMe	SOEt	Cl
5-326	OMe	SO ₂ Et	Cl
5-327	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-328	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-329	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl

10

20

30

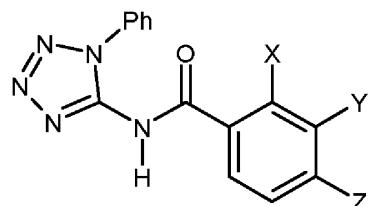
40

No.	X	Y	Z
5-330	OCH ₂ c-Pr	SMe	CF ₃
5-331	OCH ₂ c-Pr	SOMe	CF ₃
5-332	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	CF ₃
5-333	OCH ₂ c-Pr	SEt	CF ₃
5-334	OCH ₂ c-Pr	SOEt	CF ₃
5-335	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	CF ₃
5-336	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
5-337	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
5-338	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
5-339	OCH ₂ c-Pr	SMe	Cl
5-340	OCH ₂ c-Pr	SOMe	Cl
5-341	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	Cl
5-342	OCH ₂ c-Pr	SEt	Cl
5-343	OCH ₂ c-Pr	SOEt	Cl
5-344	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	Cl
5-345	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-346	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-347	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
5-348	OCH ₂ c-Pr	SMe	SO ₂ Me
5-349	OCH ₂ c-Pr	SOMe	SO ₂ Me
5-350	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	SO ₂ Me
5-351	OCH ₂ c-Pr	SEt	SO ₂ Me
5-352	OCH ₂ c-Pr	SOEt	SO ₂ Me
5-353	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	SO ₂ Me
5-354	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
5-355	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
5-356	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
5-357	SO ₂ Me	F	CF ₃
5-358	SO ₂ Me	NH ₂	CF ₃
5-359	SO ₂ Me	NHEt	Cl
5-360	SMe	SEt	F
5-361	SMe	SMe	F

表 6 : A が C Y であり、 B が N であり、 R がフェニルである本発明による一般式 (I) の化合物

【 0 0 4 3 】

【 化 7 】



【 0 0 4 4 】

10

20

30

40

【表 6】

No.	X	Y	Z
6-1	F	H	Cl
6-2	F	H	Br
6-3	F	H	SO ₂ Me
6-4	F	H	SO ₂ Et
6-5	F	H	CF ₃
6-6	F	H	NO ₂
6-7	Cl	H	F
6-8	Cl	H	Cl
6-9	Cl	H	Br
6-10	Cl	H	SMe
6-11	Cl	H	SOMe
6-12	Cl	H	SO ₂ Me
6-13	Cl	H	SO ₂ CH ₂ Cl
6-14	Cl	H	SEt
6-15	Cl	H	SO ₂ Et
6-16	Cl	H	CF ₃
6-17	Cl	H	NO ₂
6-18	Cl	H	ピラゾール-1-イル
6-19	Cl	H	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
6-20	Br	H	Cl
6-21	Br	H	Br
6-22	Br	H	SO ₂ Me
6-23	Br	H	SO ₂ Et
6-24	Br	H	CF ₃
6-25	SO ₂ Me	H	Cl
6-26	SO ₂ Me	H	Br
6-27	SO ₂ Me	H	SMe
6-28	SO ₂ Me	H	SOMe
6-29	SO ₂ Me	H	SO ₂ Me
6-30	SO ₂ Me	H	SO ₂ Et
6-31	SMe	H	CF ₃
6-32	SO ₂ Et	H	CF ₃
6-33	SO ₂ Et	H	Cl
6-34	SO ₂ Et	H	Br
6-35	SO ₂ Et	H	SMe

10

20

30

No.	X	Y	Z
6-36	SO ₂ Et	H	SOMe
6-37	SO ₂ Et	H	SO ₂ Me
6-38	SO ₂ Et	H	CF ₃
6-39	NO ₂	H	F
6-40	NO ₂	H	Cl
6-41	NO ₂	H	Br
6-42	NO ₂	H	I
6-43	NO ₂	H	CN
6-44	NO ₂	H	SO ₂ Me
6-45	NO ₂	H	SO ₂ Et
6-46	NO ₂	H	CF ₃
6-47	Me	H	Cl
6-48	Me	H	Br
6-49	Me	H	SMe
6-50	Me	H	SO ₂ Me
6-51	Me	H	SO ₂ CH ₂ Cl
6-52	Me	H	SEt
6-53	Me	H	SO ₂ Et
6-54	Me	H	CF ₃
6-55	CH ₂ SO ₂ Me	H	CF ₃
6-56	Et	H	Cl
6-57	Et	H	Br
6-58	Et	H	SMe
6-59	Et	H	SO ₂ Me
6-60	Et	H	SO ₂ CH ₂ Cl
6-61	Et	H	SEt
6-62	Et	H	SO ₂ Et
6-63	Et	H	CF ₃
6-64	CF ₃	H	Cl
6-65	CF ₃	H	Br
6-66	CF ₃	H	SO ₂ Me
6-67	CF ₃	H	SO ₂ Et
6-68	CF ₃	H	CF ₃
6-69	NO ₂	NH ₂	F
6-70	NO ₂	NHMe	F
6-71	NO ₂	NMe ₂	F
6-72	NO ₂	Me	Cl
6-73	NO ₂	NH ₂	Cl
6-74	NO ₂	NHMe	Cl
6-75	NO ₂	NMe ₂	Cl
6-76	NO ₂	NH ₂	Br
6-77	NO ₂	NHMe	Br
6-78	NO ₂	NMe ₂	Br
6-79	NO ₂	NH ₂	CF ₃
6-80	NO ₂	NMe ₂	CF ₃
6-81	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Me
6-82	NO ₂	NH ₂	SO ₂ Et
6-83	NO ₂	NHMe	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
6-84	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Me
6-85	NO ₂	NMe ₂	SO ₂ Et
6-86	NO ₂	NH ₂	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
6-87	NO ₂	NHMe	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
6-88	NO ₂	NMe ₂	1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル
6-89	Me	SMe	H
6-90	Me	SOMe	H
6-91	Me	SO ₂ Me	H
6-92	Me	SEt	H
6-93	Me	SOEt	H
6-94	Me	SO ₂ Et	H
6-95	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	H
6-96	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	H
6-97	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	H
6-98	Me	F	F
6-99	Me	F	Cl
6-100	Me	SEt	F
6-101	Me	SOEt	F
6-102	Me	SO ₂ Et	F
6-103	Me	Me	Cl
6-104	Me	F	Cl
6-105	Me	Cl	Cl
6-106	Me	NH ₂	Cl
6-107	Me	NHMe	Cl
6-108	Me	NMe ₂	Cl
6-109	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-110	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
6-111	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	Cl
6-112	Me	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
6-113	Me	O(CH ₂) ₂ -CO-NMe ₂	Cl
6-114	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NMe ₂	Cl
6-115	Me	O(CH ₂) ₂ -NH(CO)NHCO ₂ Et	Cl
6-116	Me	O(CH ₂) ₂ -NHCO ₂ Me	Cl
6-117	Me	O-CH ₂ -NSO ₂ cPr	Cl
6-118	Me	O(CH ₂) ₅ -2,4-ジメチル-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン	Cl
6-119	Me	O(CH ₂) ₃ -3,5-ジメチル-1,2-オキサゾール-4-イル	Cl
6-120	Me	SMe	Cl
6-121	Me	SOMe	Cl
6-122	Me	SO ₂ Me	Cl
6-123	Me	SEt	Cl
6-124	Me	SOEt	Cl
6-125	Me	SO ₂ Et	Cl

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
6-126	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-127	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-128	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-129	Me	NH ₂	Br
6-130	Me	NHMe	Br
6-131	Me	NMe ₂	Br
6-132	Me	O(CH ₂)-(CO)N ₂ E _t ₂	Br
6-133	Me	O(CH ₂)-5-ピロリジン-2-オ ン	Br
6-134	Me	SMe	Br
6-135	Me	SOMe	Br
6-136	Me	SO ₂ Me	Br
6-137	Me	SEt	Br
6-138	Me	SOEt	Br
6-139	Me	SO ₂ Et	Br
6-140	Me	SMe	I
6-141	Me	SOMe	I
6-142	Me	SO ₂ Me	I
6-143	Me	SEt	I
6-144	Me	SOEt	I
6-145	Me	SO ₂ Et	I
6-146	Me	Cl	CF ₃
6-147	Me	SMe	CF ₃
6-148	Me	SOMe	CF ₃
6-149	Me	SO ₂ Me	CF ₃
6-150	Me	SEt	CF ₃
6-151	Me	SOEt	CF ₃
6-152	Me	SO ₂ Et	CF ₃
6-153	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
6-154	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
6-155	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
6-156	Me	Me	SO ₂ Me
6-157	Me	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾ ール-3-イル	SO ₂ Me
6-158	Me	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾ ール-3-イル	SO ₂ Et
6-159	Me	5-シアノメチル-4,5-ジヒド ロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
6-160	Me	5-シアノメチル-4,5-ジヒド ロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
6-161	Me	NH ₂	SO ₂ Me
6-162	Me	NHMe	SO ₂ Me
6-163	Me	NMe ₂	SO ₂ Me
6-164	Me	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-165	Me	ピラゾール-1-イル	SO ₂ Me
6-166	Me	OH	SO ₂ Me
6-167	Me	OMe	SO ₂ Me
6-168	Me	OMe	SO ₂ Et

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
6-169	Me	OEt	SO ₂ Me
6-170	Me	OEt	SO ₂ Et
6-171	Me	OiPr	SO ₂ Me
6-172	Me	OiPr	SO ₂ Et
6-173	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-174	Me	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
6-175	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
6-176	Me	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
6-177	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
6-178	Me	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
6-179	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Me
6-180	Me	O(CH ₂) ₂ NHSO ₂ Me	SO ₂ Et
6-181	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
6-182	Me	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
6-183	Me	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Me
6-184	Me	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Et
6-185	Me	O(CH ₂) ₂ -O(3,5-ジメトキシピリミジン-2-イル)	SO ₂ Me
6-186	Me	Cl	SO ₂ Me
6-187	Me	SMe	SO ₂ Me
6-188	Me	SOME	SO ₂ Me
6-189	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
6-190	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Et
6-191	Me	SEt	SO ₂ Me
6-192	Me	SOEt	SO ₂ Me
6-193	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me
6-194	Me	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-195	Me	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-196	Me	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-197	CH ₂ SMe	OMe	SO ₂ Me
6-198	CH ₂ OMe	OMe	SO ₂ Me
6-199	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OEt	SO ₂ Me
6-200	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OEt	SO ₂ Me
6-201	CH ₂ O(CH ₂) ₃ OMe	OMe	SO ₂ Me
6-202	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-203	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	NH(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
6-204	Et	SMe	Cl
6-205	Et	SO ₂ Me	Cl
6-206	Et	SMe	CF ₃
6-207	Et	SO ₂ Me	CF ₃
6-208	Et	F	SO ₂ Me

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
6-209	Et	NH(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-210	iPr	SO ₂ Me	CF ₃
6-211	cPr	SO ₂ Me	CF ₃
6-212	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	F
6-213	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	F
6-214	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	F
6-215	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	F
6-216	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-217	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Cl
6-218	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Cl
6-219	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	Cl
6-220	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	Br
6-221	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	Br
6-222	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	Br
6-223	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	Br
6-224	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	I
6-225	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	I
6-226	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	I
6-227	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	I
6-228	CF ₃	F	SO ₂ Me
6-229	CF ₃	F	SO ₂ Et
6-230	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-231	CF ₃	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
6-232	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
6-233	CF ₃	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
6-234	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Me
6-235	CF ₃	OCH ₂ CONMe ₂	SO ₂ Et
6-236	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Me
6-237	CF ₃	[1,4]ジオキサン-2-イル-メトキシ	SO ₂ Et
6-238	F	SMe	CF ₃
6-239	F	SOMe	CF ₃
6-240	Cl	Me	Cl
6-241	Cl	OCH ₂ CHCH ₂	Cl
6-242	Cl	OCH ₂ CHF ₂	Cl
6-243	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-244	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	Cl
6-245	Cl	O(CH ₂)-5-ピロリジン-2-オ ン	Cl
6-246	Cl	SMe	Cl
6-247	Cl	SOMe	Cl
6-248	Cl	SO ₂ Me	Cl
6-249	Cl	F	SMe

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
6-250	Cl	Cl	SO ₂ Me
6-251	Cl	COOMe	SO ₂ Me
6-252	Cl	CONMe ₂	SO ₂ Me
6-253	Cl	CONMe(OMe)	SO ₂ Me
6-254	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me
6-255	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Et
6-256	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Me
6-257	Cl	CH ₂ OEt	SO ₂ Et
6-258	Cl	CH ₂ OCH ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
6-259	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
6-260	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Et
6-261	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ Me
6-262	Cl	CH ₂ Oc-ペンチル	SO ₂ Me
6-263	Cl	CH ₂ PO(OMe) ₂	SO ₂ Me
6-264	Cl	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SMe
6-265	Cl	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
6-266	Cl	4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
6-267	Cl	5-シアノメチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Me
6-268	Cl	5-シアノメチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
6-269	Cl	5-(メトキシメチル)-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
6-270	Cl	5-(メトキシメチル)-5-メチル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル	SO ₂ Et
6-271	Cl	CH ₂ O-テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Me
6-272	Cl	CH ₂ O-テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Et
6-273	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-2-イル	SO ₂ Me
6-274	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-2-イル	SO ₂ Et
6-275	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Me
6-276	Cl	CH ₂ OCH ₂ -テトラヒドロフラン-3-イル	SO ₂ Et
6-277	Cl	OMe	SO ₂ Me
6-278	Cl	OMe	SO ₂ Et
6-279	Cl	OEt	SO ₂ Me
6-280	Cl	OEt	SO ₂ Et
6-281	Cl	OiPr	SO ₂ Me
6-282	Cl	OiPr	SO ₂ Et

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
6-283	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-284	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
6-285	Cl	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
6-286	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
6-287	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
6-288	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-289	Cl	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
6-290	Cl	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Me
6-291	Cl	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Et
6-292	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Me
6-293	Cl	OCH ₂ (CO)NMe ₂	SO ₂ Et
6-294	Cl	SMe	SO ₂ Me
6-295	Cl	SOMe	SO ₂ Me
6-296	Br	OMe	Br
6-297	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	Br
6-298	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-299	Br	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
6-300	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
6-301	Br	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
6-302	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
6-303	Br	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
6-304	Br	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Me
6-305	Br	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Et
6-306	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-307	I	O(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Et
6-308	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me
6-309	I	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Et
6-310	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Me
6-311	I	O(CH ₂) ₄ OMe	SO ₂ Et
6-312	I	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Me
6-313	I	[1,4]ジオキサン-2-イル-メト キシ	SO ₂ Et
6-314	OMe	SMe	CF ₃
6-315	OMe	SOMe	CF ₃
6-316	OMe	SO ₂ Me	CF ₃
6-317	OMe	SOEt	CF ₃
6-318	OMe	SO ₂ Et	CF ₃
6-319	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
6-320	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
6-321	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
6-322	OMe	SMe	Cl
6-323	OMe	SOMe	Cl
6-324	OMe	SO ₂ Me	Cl

10

20

30

40

No.	X	Y	Z
6-325	OMe	SEt	Cl
6-326	OMe	SOEt	Cl
6-327	OMe	SO ₂ Et	Cl
6-328	OMe	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-329	OMe	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-330	OMe	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-331	OCH ₂ c-Pr	SMe	CF ₃
6-332	OCH ₂ c-Pr	SOMe	CF ₃
6-333	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	CF ₃
6-334	OCH ₂ c-Pr	SEt	CF ₃
6-335	OCH ₂ c-Pr	SOEt	CF ₃
6-336	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	CF ₃
6-337	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
6-338	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
6-339	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	CF ₃
6-340	OCH ₂ c-Pr	SMe	Cl
6-341	OCH ₂ c-Pr	SOMe	Cl
6-342	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	Cl
6-343	OCH ₂ c-Pr	SEt	Cl
6-344	OCH ₂ c-Pr	SOEt	Cl
6-345	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	Cl
6-346	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-347	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-348	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Cl
6-349	OCH ₂ c-Pr	SMe	SO ₂ Me
6-350	OCH ₂ c-Pr	SOMe	SO ₂ Me
6-351	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	SO ₂ Me
6-352	OCH ₂ c-Pr	SEt	SO ₂ Me
6-353	OCH ₂ c-Pr	SOEt	SO ₂ Me
6-354	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	SO ₂ Me
6-355	OCH ₂ c-Pr	S(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-356	OCH ₂ c-Pr	SO(CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-357	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	SO ₂ Me
6-358	SO ₂ Me	F	CF ₃
6-359	SO ₂ Me	NH ₂	CF ₃
6-360	SO ₂ Me	NHEt	Cl
6-361	SMe	SEt	F
6-362	SMe	SMe	F

10

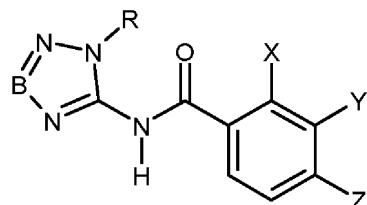
20

30

表 7 : A が C Y である本発明による一般式 (I) の化合物

【 0 0 4 5 】

【 化 8 】



【 0 0 4 6 】

40

【表7】

No.	B	R	X	Y	Z
7-1	CH	nPr	Cl	H	SO ₂ Me
7-2	CH	iPr	Cl	H	SO ₂ Me
7-3	N	nPr	Cl	H	SO ₂ Me
7-4	N	iPr	Cl	H	SO ₂ Me
7-5	N	cPr	Cl	H	SO ₂ Me
7-6	N	アリル	Cl	H	SO ₂ Me
7-7	N	CH ₂ OMe	Cl	H	SO ₂ Me
7-8	CH	nPr	NO ₂	H	SO ₂ Me
7-9	CH	iPr	NO ₂	H	SO ₂ Me
7-10	N	nPr	NO ₂	H	SO ₂ Me
7-11	N	iPr	NO ₂	H	SO ₂ Me
7-12	N	cPr	NO ₂	H	SO ₂ Me
7-13	N	アリル	NO ₂	H	SO ₂ Me
7-14	N	CH ₂ OMe	NO ₂	H	SO ₂ Me
7-15	CH	nPr	SO ₂ Me	H	CF ₃
7-16	CH	iPr	SO ₂ Me	H	CF ₃
7-17	N	nPr	SO ₂ Me	H	CF ₃
7-18	N	iPr	SO ₂ Me	H	CF ₃
7-19	N	cPr	SO ₂ Me	H	CF ₃
7-20	N	アリル	SO ₂ Me	H	CF ₃
7-21	N	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	H	CF ₃
7-22	CH	nPr	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
7-23	CH	iPr	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
7-24	N	nPr	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
7-25	N	iPr	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
7-26	N	cPr	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
7-27	N	アリル	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
7-28	N	CH ₂ OMe	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me
7-29	CH	nPr	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-30	CH	iPr	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-31	CH	ピリド-2-イル	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-32	N	nPr	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-33	N	iPr	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-34	N	cPr	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-35	N	アリル	Me	SO ₂ Me	CF ₃

10

20

30

No.	B	R	X	Y	Z
7-36	N	CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-37	N	CH ₂ (CO)Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-38	N	CH ₂ COOEt	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-39	N	4-Cl-ベンジル	Me	SO ₂ Me	CF ₃
7-40	CH	nPr	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
7-41	CH	iPr	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
7-42	N	nPr	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
7-43	N	iPr	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
7-44	N	cPr	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
7-45	N	CH ₂ OMe	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
7-46	N	CH ₂ (CO)Me	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
7-47	N	CH ₂ COOEt	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me
7-48	N	4-Cl-ベンジル	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me

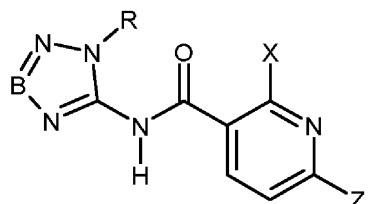
10

表 8 : A が N である本発明による一般式 (I) の化合物

【 0 0 4 7 】

【 化 9 】

20



【 0 0 4 8 】

【表8】

No.	B	R	X	Z
8-1	CH	Me	Cl	Cl
8-2	N	Me	Cl	Cl
8-3	CH	Me	Me	Cl
8-4	N	Me	Me	Cl
8-5	CH	Me	Cl	SMe
8-6	N	Me	Cl	SMe
8-7	CH	Me	Me	SO ₂ Me
8-8	N	Me	Me	SO ₂ Me
8-9	CH	Me	Cl	CF ₃
8-10	N	Me	Cl	CF ₃
8-11	CH	Ph	Cl	CF ₃
8-12	N	Ph	Cl	CF ₃
8-13	N	CH ₂ (CO)Me	Cl	CF ₃
8-14	N	ベンゾイル	Cl	CF ₃
8-15	N	アリル	Cl	CF ₃
8-16	N	4-Cl-ベンジル	Cl	CF ₃
8-17	N	CH ₂ CO ₂ Et	Cl	CF ₃
8-18	CH	Me	Me	CF ₃
8-19	N	Me	Me	CF ₃
8-20	CH	Me	CH ₂ OMe	CF ₃
8-21	N	Me	CH ₂ OMe	CF ₃
8-22	CH	Me	CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe	CF ₃
8-23	N	Me	CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe	CF ₃

欧洲特許出願「EP 1 0 1 7 4 8 9 3」(2010年9月1日にEPOでBayer CropScience AGの名で出願)およびその相当する国際特許出願PCT/EP 2011/064820すでに開示されているように、本発明に従って使用される式(I)の化合物および/またはそれらの塩は、下記において共に「本発明による化合物」とも称され、広いスペクトラムの経済的に重要な単子葉および双子葉一年生有害植物に対する優れた除草効力を有する。当該活性化合物は、根茎、台木および他の多年生器官から芽を生じ、防除が困難である多年生雑草に対してであっても有効に作用する。

【0049】

従って本発明は、(I)(a)カラスマギ属、好ましくはカラスマギ(Avenasativa)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(Pseudomonas)、好ましくは蛍光菌(Pseudomonas fluorescens)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ(Synechococcoidae)、好ましくはシネココッカス(Synechococcus)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(Blepharismaidæ)、好ましくはブレファリスマ・ジャボニクム(Blepharisma japonicum)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(Rhodococcus)、好ましくはロドコッカス(Rhodococcus)属種(RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(Rhodococcus)属種(RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA

10

20

30

40

50

配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードするDNA配列を含み、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含むものを含む1以上のキメラ遺伝子を含むことでHPPD阻害薬型除草剤に対して耐性であるトランスジェニック作物の区域において望ましくない植物を防除する方法であつて、植物(例えば単子葉もしくは双子葉雑草もしくは望ましくない作物などの有害植物)、種子(例えば穀粒、種子もしくは栄養繁殖体(*vegetative propagules*)、例えば塊茎もしくは芽が出た苗条部分)または植物が成長する区域(例えば耕作下の区域)に、上記で定義の1以上のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミドを施用することを含む方法に関するものである。具体例としては、本発明による化合物によって防除することができる単子葉および双子葉雑草叢のいくつかの代表的なものを挙げることができるが、列記は一定の種類に限定されるものではない。
10
20

【0050】

单子葉有害植物の属:エギロップス属(*Aegilops*)、カモジグサ属(*Agropyron*)、コヌカグサ属(*Agrostis*)、スズメノテッポウ属(*Alopecurus*)、セイヨウヌカボ属(*Apera*)、カラスマギ属(*Avena*)、ニクキビ属(*Brachiaria*)、スズメノチャヒキ属(*Bromus*)、クリノイガ属(*Cenchrus*)、ツユクサ属(*Commelina*)、ギヨウギシバ属(*Cynodon*)、カヤツリグサ属(*Cyperus*)、タツノツメガヤ属(*Dactyloctenium*)、メヒシバ属(*Digitaria*)、ヒ工属(*Echinochloa*)、ハリイ属(*Eleocharis*)、オヒシバ属(*Eleusine*)、カゼクサ属(*Eragrostis*)、ナルコビ工属(*Eriochloa*)、ウシノケグサ属(*Festuca*)、テンツキ属(*Fimbristylis*)、アメリカコナギ属(*Heteranthera*)、チガヤ属(*Imperata*)、カモノハシ属(*Ischaemum*)、アゼガヤ属(*Leptochloa*)、ドクムギ属(*Lolium*)、ミズアオイ属(*Monocephala*)、キビ属(*Panicum*)、スズメノヒ工属(*Paspalum*)、クサヨシ属(*Phalaris*)、アワガエリ属(*Phleum*)、イチゴツナギ属(*Poa*)、ツノアイアシ属(*Rottboellia*)、オモダカ属(*Sagittaria*)、アブラガヤ属(*Scirpus*)、エノコログサ属(*Setaria*)、モロコシ属(*Sorghum*)。
30
40

【0051】

双子葉雑草の属:イチビ属(*Abutilon*)、ヒユ属(*Amaranthus*)、ブタクサ属(*Ambrosia*)、アノダ属(*Anoda*)、カミツレモドキ属(*Antennaria*)、アファネス(*Aphanes*)、ヨモギ属(*Artemisia*)、アトリプレックス属(*Atriplex*)、ヒナギク属(*Bellis*)、センダングサ属(*Bidens*)、ナズナ属(*Capsella*)、ヒレアザミ属(*Carduus*)、ナンバンサイカチ属(*Cassia*)、ヤグルマギク属(*Centaurea*)、アカザ属(*Chenopodium*)、アザミ属(*Cirsium*)、セイヨウヒルガオ属(*Convolvulus*)、チョウセンアサガオ属(*Datura*)、ヌスピトハギ属(*Desmodium*)、エメリクス(*Emex*)、エゾスズシロ属(*Erysimum*)、ト
50

ウダイグサ属 (*Euphorbia*)、チシマオドリコソウ属 (*Galeopsis*)、コゴメギク属 (*Galinsoga*)、ヤエムグラ属 (*Gallium*)、フヨウ属 (*Hibiscus*)、サツマイモ属 (*Ipomoea*)、ホウキギ属 (*Kochia*)、オドリコソウ属 (*Lamium*)、マメグンバイナズナ属 (*Lepidium*)、アゼナ属 (*Lindernia*)、シカレギク属 (*Matricaria*)、ハッカ属 (*Mentha*)、ヤマアイ属 (*Mercurialis*)、ムルゴ (*Mullugo*)、ワスレナグサ属 (*Myosotis*)、ケシ属 (*Papaver*)、アサガオ属 (*Pharbitis*)、オオバコ属 (*Plantago*)、タデ属 (*Polygonum*)、スペリヒユ属 (*Portulaca*)、キンポウゲ属 (*Ranunculus*)、ダイコン属 (*Raphanus*)、イヌガラシ属 (*Rorippa*)、キカシグサ属 (*Rotala*)、スイバ属 (*Rumex*)、オカヒジキ属 (*Salsola*)、キオン属 (*Senecio*)、ツノクサネム属 (*Sesbania*)、キンゴジカ属 (*Sida*)、シロガラシ属 (*Sinapis*)、ナス属 (*Solanum*)、ハチジョウナ属 (*Sonchus*)、ナガボノウルシ属 (*Sphenoclea*)、ハコベ属 (*Stellaria*)、タンポポ属 (*Taraxacum*)、ゲンバイナズナ属 (*Thlaspi*)、ジャジクソウ属 (*Trifolium*)、イラクサ属 (*Urtica*)、クワガタソウ属 (*Veronica*)、スミレ属 (*Viola*)、オナモミ属 (*Xanthium*)。 10

【0052】

上記で定義のN - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくはN - (トリアゾール - 3 - イル)アリールカルボキサミドを施用することができると考えられる経済的に重要な作物のトランスジェニック作物は、例えばラッカセイ属 (*Arachis*)、フダンソウ属 (*Beta*)、アブラナ属 (*Brassica*)、キュウリ属 (*Cucumis*)、カボチャ属 (*Cucurbita*)、ヒマワリ属 (*Helianthus*)、ニンジン属 (*Daucus*)、ダイズ属 (*Glycine*)、ワタ属 (*Gossypium*)、サツマイモ属 (*Ipomoea*)、アキノノゲシ属 (*Lactuca*)、アマ属 (*Linum*)、トマト属 (*Lycopersicon*)、タバコ属 (*Nicotiana*)、インゲンマメ属 (*Phaseolus*)、エンドウ属 (*Pisum*)、ナス属 (*Solanum*)、ソラマメ属 (*Vicia*)の双子葉作物、またはネギ属 (*Allium*)、アナス属 (*Ananas*)、アスパラガス属 (*Asparagus*)、カラスムギ属 (*Avena*)、オオムギ属 (*Hordeum*)、イネ属 (*Oryza*)、キビ属 (*Panicum*)、サトウキビ属 (*Saccharum*)、ライムギ属 (*Secale*)、モロコシ属 (*Sorghum*)、ライコムギ属 (*Triticale*)、コムギ属 (*Triticum*)、トウモロコシ属 (*Zea*)の单子葉作物、特にはトウモロコシ属 (*Zea*)およびコムギ属 (*Triticum*)である。これが理由で、本発明は好ましくは、(I)(a)カラスムギ属、好ましくはカラスムギ (*Avenasativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス (*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌 (*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ (*Synechococcoidae*)、好ましくはシネココッカス (*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ (*Blepharisnidiae*)、好ましくはブレファリスマ・ジャボニクム (*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス (*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス (*Rhodococcus*)属種 (RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス (*Rhodococcus*)属種 (RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科 20 30 40 50

(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス (*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア (*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ (*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルビルビン酸ジオキシゲナーゼ (HPPD) をコードするDNA配列を含み、または(I)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含むものを含む1以上のキメラ遺伝子を含むことでHPPD阻害薬型除草剤に対して耐性であるトランスジェニック作物の区域において望ましくない植物を防除する方法であって、ラッカセイ属 (*Arachis*)、フダンソウ属 (*Beta*)、アブラナ属 (*Brassica*)、キュウリ属 (*Cucumis*)、カボチャ属 (*Cucurbita*)、ヒマワリ属 (*Helianthus*)、ニンジン属 (*Daucus*)、ダイズ属 (*Glycine*)、ワタ属 (*Gossypium*)、サツマイモ属 (*Ipomoea*)、アキノノゲシ属 (*Lactuca*)、アマ属 (*Linum*)、トマト属 (*Lycopersicon*)、タバコ属 (*Nicotiana*)、インゲンマメ属 (*Phaseolus*)、エンドウ属 (*Pisum*)、ナス属 (*Solanum*)、ソラマメ属 (*Vicia*) の双子葉作物、またはネギ属 (*Allium*)、アナanas属 (*Ananas*)、アスパラガス属 (*Asparagus*)、カラスムギ属 (*Avena*)、オオムギ属 (*Hordeum*)、イネ属 (*Oryza*)、キビ属 (*Panicum*)、サトウキビ属 (*Saccharum*)、ライムギ属 (*Secale*)、モロコシ属 (*Sorghum*)、ライコムギ属 (*Triticale*)、コムギ属 (*Triticum*)、トウモロコシ属 (*Zea*) の单子葉作物、特にはトウモロコシ属 (*Zea*) およびコムギ属 (*Triticum*)において、植物 (例えば单子葉もしくは双子葉雑草もしくは望ましくない作物などの有害植物)、種子 (例えば穀粒、種子もしくは栄養繁殖体 (*vegetative propagules*)、例えは塊茎もしくは芽が出た苗条部分) または植物が成長する区域 (例えば、耕作下の区域) に、上記で定義の1以上のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミドを施用することを含む方法に関するものである。

【0053】

有用な植物および観賞植物の、例えばコムギ、オオムギ、ライムギ、カラスムギ、モロコシ/キビ、イネ、キャッサバおよびトウモロコシなどの穀類またはサトウダイコン、サトウキビ、ワタ、ダイズ、アブラナ、ジャガイモ、トマト、エンドウマメおよび他の野菜の作物の経済的に重要なトランスジェニック作物において上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩を用いることが好ましく、その作物は(I)(a)カラスムギ属、好ましくはカラスムギ (*Avena sativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス (*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌 (*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ (*Synechococcoideae*)、好ましくはシネココッカス (*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ (*Blepharisma*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム (*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス (*Rhodococcus*)、好ましく

はロドコッカス (*Rhodococcus*) 属種 (RHA1株)、分離株 r003041 、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス (*Rhodococcus*) 属種 (RHA1株)、分離株 r002040 、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科 (*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス (*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア (*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ (*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルビルビン酸ジオキシゲナーゼ (HPPD) をコードするDNA配列を含み、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含むものを含む1以上のキメラ遺伝子を含む。

【0054】

本発明はさらに、植物の形質転換方法における、マーカー遺伝子としてまたはHPPD阻害薬である除草剤に対する植物耐性を与えることを可能とするコード配列としてHPPDをコードする核酸の使用、ならびに(I)(a)カラスマギ属、好ましくはカラスマギ (*Avenasativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス (*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌 (*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ (*Synechococcoidae*)、好ましくはシネココッカス (*Synechococcus*) 属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ (*Blepharismaidae*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム (*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス (*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス (*Rhodococcus*) 属種 (RHA1株)、分離株 r003041 、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス (*Rhodococcus*) 属種 (RHA1株)、分離株 r002040 、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科 (*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス (*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア (*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ (*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルビルビン酸ジオキシゲナーゼ (HPPD) をコードするDNA配列を含み、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含むものを含む1以上のキメラ遺伝子を含む植物での上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカ

10

20

30

40

50

ルボキサミド類もしくはそれらの塩の使用に関するものもある。

【0055】

作物の商業的生産では、信頼性の高い農薬管理下で、作物農地から望ましくない植物（即ち、「雑草」）を除去することが望まれる。理想的な処理は、農地全体に施用することができる処理であるが、作物に影響を与えることなく、望ましくない植物のみを除去することができる処理であると考えられる。そのような処理システムの一つは、除草剤に耐性を有する作物の使用であって、それによって、除草剤が除草剤耐性作物の農地に散布されたとき、除草剤耐性ではない雑草が死滅するか、または重大な損傷を受ける一方で、作物が成長し続ける使用が関与するものである。理想的には、そのような処理システムは、雑草の防除により適応性と経済性の最良の可能な組み合わせが提供されるように、除草剤特性を変更する利点を有するであろう。例えば、個々の除草剤は農地で異なる寿命を有しており、一部の除草剤は長く持続して、農地に施用後も比較的長期間有効であるが、一方で、他の除草剤は、急速に分解して他の化合物および／または非活性な化合物となる。理想的な処理システムは、栽培者が除草剤の選択を特定の状況に合わせて調整することができるよう異なる除草剤の使用が可能とするものであると考えられる。10

【0056】

多数の除草剤耐性作物が現在市販されているが、多くの市販の除草剤および除草剤／作物の組み合わせに関して生じている一つの問題は、個々の除草剤が、代表的には、共通の雑草種に対して不十分な活性スペクトラムを有することである。以前から使用されてきた各除草剤の多くに関して、除草剤に耐性の雑草種の集団およびバイオタイプがさらに蔓延するようになった（例えば、Tranel and Wright (2002) Weed Science 50: 700-712; Owen and Zelaya (2005) Pest Manag. Sci. 61:301-311参照）。複数の除草剤に耐性を有するトランスジェニック植物が記載されている（例えば、WO 2005/012515 参照）。しかし、作物生産のあらゆる局面の改善、雑草の防除の選択肢、残留雑草防除の拡大、および作物収量の改善が引き続き求められている。20

【0057】

上記で定義のN-（テトラゾール-4-イル）-もしくはN-（トリアゾール-3-イル）アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩の種類に属するHPPD阻害薬型除草剤に対して耐性を示す上でトランスジェニック植物において機能する1以上のHPPDタンパク質をコードする上記で定義のキメラ遺伝子もしくはその突然変異体は、植物において、そのような植物に有用な農学的特性を付与するタンパク質またはRNAをコードする他の遺伝子と組み合わせることが有利である。形質転換植物に有用な農学的特性を付与するタンパク質またはRNAをコードする遺伝子の中で、化学構造に基づきHPPD阻害型除草剤とは異なる1以上の除草剤に対する耐性を付与するタンパク質をコードするDNA配列、およびある種の昆虫に対する耐性を付与する他のもの、ある種の病気および／または生物ストレスおよび非生物ストレスに対して耐性を付与するもの、線虫または昆虫防除を提供するRNAをコードするDNAなどを挙げることができる。30

【0058】

そのような遺伝子は、特に、公開PCT特許出願WO 91/02071およびWO 95/06128に記載されている。40

【0059】

形質転換植物細胞および植物に、ある種の除草剤に対する耐性を付与するタンパク質をコードするDNA配列の中で、グルホシネート除草剤に対する耐性を付与するWO 2009/152359に記載のbarもしくはPAT遺伝子またはストレプトミセス・コエリコロール(Streptomyces coelicolor)遺伝子、グリホセートおよびその塩などの標的としてEPSPSを有する除草剤に対する耐性を付与する好適なEPSPSをコードする遺伝子(US 4,535,060, US 4,769,061, US 5,094,945, US 4,940,835, US 5,188,642, US 4,971,908, US 5,145,783, US 5,310,667, US 5,312,9150

0、USS5, 627, 061、USS5, 633, 435)、またはグリホセートオキシドレダクターゼをコードする遺伝子(USS5, 463, 175)を挙げることができる。

【0060】

標的としてEPSPSを有する除草剤に対する耐性を付与する好適なEPSPSをコードするDNA配列の中で、より詳細には、植物EPSPS、特に、トウモロコシEPSPS、特には二つの突然変異、特にはアミノ酸102位の突然変異とアミノ酸106位の突然変異を含むトウモロコシEPSPSをコードする遺伝子(WO2004/074443)であり、本明細書下記で二重突然変異トウモロコシEPSPSまたは2mEPSPSと称されるアグロバクテリウム(特許出願US6566587に記載の遺伝子、またはアグロバクテリウム(Agrobacterium)から単離されたEPSPSをコードし、米国特許第5,633,435号の配列番号2および配列番号3で記載される遺伝子(CP4とも称される)が挙げられる。

10

【0061】

標的としてEPSPSを有する除草剤に対する耐性を付与する好適なEPSPSをコードするDNA配列の中で、詳細には、アルトロバクター・グロビホルミス(Arthrobacter globiformis)由来のEPSPS GRG23をコードする遺伝子、さらには、突然変異体GRG23 ACE1、GRG23 ACE2またはGRG23 ACE3、特にはWO2008/100353に記載されているGRG23の突然変異体およびバリエント、例えば、WO2008/100353の配列番号29のGRG23(ace3)R173Kが挙げられる。

20

【0062】

EPSPSをコードする、より詳細には、上記遺伝子をコードするDNA配列の場合、これらの酵素をコードする配列の前に、輸送ペプチドをコードする配列、特には米国特許第5,510,471号または第5,633,448号に記載の「最適化された輸送ペプチド」が先行することが有利である。

【0063】

WO2007/024782では、グリホセートおよび少なくとも一つのALS(アセト乳酸シンターゼ)阻害剤に耐性を有する植物が開示されている。より具体的には、GAT(グリホセート-N-アセチルトランスフェラーゼ)ポリペプチドおよびALS阻害剤に対する耐性を付与するポリペプチドをコードする遺伝子を含有する植物が開示されている。

30

【0064】

USS6, 855, 533では、突然変異アラビドプシス(Arabidopsis)ALS/AHAS遺伝子を含有するトランジェニックタバコ植物が開示されている。

【0065】

USS6, 153, 401では、代謝により、2, 4-D(2, 4-ジクロロフェノキシ酢酸)に対する耐性を付与する2, 4-D-モノオキシゲナーゼをコードする遺伝子を含有する植物が開示されている。

【0066】

USS2008/0119361およびUSS2008/0120739では、代謝により、ジカンバ(3, 6-ジクロロ-2-メトキシ安息香酸)に対する耐性を付与するジカンバモノオキシゲナーゼをコードする遺伝子を含有する植物が開示されている。

40

【0067】

WO2011/028833およびWO2011/028832では、アロキシジム、ブトロキシジム、クレトジム、クロプロキシジム、シクロキシジム、セトキシジム、テブラロキシジム、トラルコキシジム、クロラジホップ、クロジナホップ、クロホップ(c1ofop)、ジクロホップ、フェノキサプロップ、フェノキサプロップ-P、フェンチアプロップ、フルアジホップ、フルアジホップ-P、ハロキシホップ、ハロキシホップ-P、イソキサピリホップ、プロパキザホップ、キザロホップ、キザロホップ-P、トリホップ(trifop)およびピノキサデンまたはこれら除草剤のいずれかの農業的に許容される

50

塩もしくはエステルからなる群から選択される少なくとも1種類の除草剤に対する耐性を与える突然変異もしくは組換えアセチル-コエンザイム-Aカルボキシラーゼ(ACCase)をコードする遺伝子を含む植物が開示されている。

【0068】

上記の除草剤耐性形質はいずれも、(I)(a)カラスムギ属、好ましくはカラスムギ(*Avena sativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ(*Synechococcus ideae*)、好ましくはシネココッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(*Blepharisma midae*)、好ましくはブレファリスマ・ジャボニクム(*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株ro03041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株ro02040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルビルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードするDNA配列を含み、または(I)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含むものを含む1以上のキメラ遺伝子を含むことによって上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩に関する植物でのHPPD耐性を示す形質と組み合わせることができる。

【0069】

昆虫に対する耐性特性に関するタンパク質をコードするDMA配列の中で、詳細には、文献に広く記載されており、当業者に公知のBtタンパク質を挙げることができる。フォトラップダス(*Photorhabdus*)などの細菌から抽出されたタンパク質も挙げられる(WO97/17432およびWO98/08932)。

【0070】

昆虫に対する新規な耐性特性を付与する対象のタンパク質をコードするそのようなDNA配列の中で、詳細には、文献に広く記載されており、当業者に公知のBtCryまたはVIPタンパク質を挙げができる。これらは、Cry1Fタンパク質またはCry1Fタンパク質から誘導されるハイブリッド(例えば、US6,326,169; US6,281,016; US6,218,188に記載のハイブリッドCry1A-Cry1Fタンパク質、またはその毒性断片)、Cry1A型タンパク質またはその毒性断片、好ましくは、Cry1Acタンパク質またはCry1Acタンパク質から誘導されるハイブリッド(例えば、US5,880,275に記載のハイブリッドCry1Ab

- C r y 1 A c タンパク質) または E P 4 5 1 8 7 8 に記載されている C r y 1 A b もしくは B t 2 タンパク質またはその殺虫性断片、 W O 0 2 / 0 5 7 6 6 4 に記載されている C r y 2 A e 、 C r y 2 A f または C r y 2 A g タンパク質またはその毒性断片、 W O 2 0 0 7 / 1 4 0 2 5 6 に記載の C r y 1 A . 1 0 5 タンパク質(配列番号7) またはその毒性断片、 N C B I 寄託番号 A B G 2 0 4 2 8 の V I P 3 A a 1 9 タンパク質、 N C B I 寄託番号 A B G 2 0 4 2 9 の V I P 3 A a 2 0 タンパク質(W O 2 0 0 7 / 1 4 2 8 4 0 の配列番号2) 、 C O T 2 0 2 または C O T 2 0 3 のコットンイベントで產生された V I P 3 A タンパク質(それぞれ、 W O 2 0 0 5 / 0 5 4 4 7 9 および W O 2 0 0 5 / 0 5 4 4 8 0) 、 W O 0 1 / 4 7 9 5 2 に記載の C r y タンパク質、 E s t r u c h l a (1 9 9 6) 、 P r o c N a t l A c a d S c i U S A . 2 8 ; 9 3 (1 1) : 5 3 8 9 - 9 4 および U S 6 , 2 9 1 , 1 5 6 に記載の V I P 3 A a タンパク質またはその毒性断片、ゼノラブダス(X e n o r h a b d u s) 由来の殺虫性タンパク質(W O 9 8 / 5 0 4 2 7 に記載のもの) 、セラチア(S e r r a t i a) 種株(特に、セラチア・エントモフィラ(S . e n t o m o p h i l a) 由来) またはフォトラブダス(P h o t o r h a b d u s) 種株、例えば、 W O 9 8 / 0 8 9 3 2 に記載のフォトラブダス(P h o t o r h a b d u s) 由来の T c - タンパク質(例えば、 W a t e r f i e l d et al . , 2 0 0 1 , A p p l E n v i r o n M i c r o b i o l . 6 7 (1 1) : 5 0 1 7 - 2 4 ; F f r e n c h - C o n s t a n t a n d B o w e n , 2 0 0 0 , C e l l M o l L i f e S c i . ; 5 7 (5) : 8 2 8 - 3 3) を含む。また、いくつかの(1 から 1 0 、好ましくは、 1 から 5) アミノ酸が、上記配列、特に、その毒性断片の配列のいずれかと異なっているか、または輸送ペプチド、例えば、色素体輸送ペプチド、または別のタンパク質またはペプチドに融合している、これらのタンパク質のいずれか一つのバリエントまたは突然変異体も本発明に含まれる。

【 0 0 7 1 】

本発明はまた、宿主生物において、特には植物細胞もしくは植物において機能することができる 5 および / または 3 位、少なくとも 5 位にコード配列ならびに異種調節要素を有するキメラ遺伝子(または発現カセット) を含むトランスジェニック植物での上記で定義の N - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくは N - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩の使用であって、当該コード配列が、(I) (a) カラスムギ属、好ましくはカラスムギ(A v e n a s a t i v a) 、より好ましくは配列番号 2 によって定義される H P P D をコードする配列番号 1 と同一の D N A 配列を含むもの、(b) シュードモナス(P s e u d o m o n a s) 、好ましくは蛍光菌(P s e u d o m o n a s f l u o r e s c e n s) 、より好ましくは配列番号 4 によって定義される H P P D をコードする配列番号 3 と同一の D N A 配列を含むもの、(c) シネココッコイデアエ(S y n e c h o c o c c o i d e a e) 、好ましくはシネココッカス(S y n e c h o c o c c u s) 属種、より好ましくは配列番号 7 によって定義される H P P D をコードする配列番号 6 と同一の D N A 配列を含むもの、(d) アミカ(B l e p h a r i s m i d a e) 、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム(B l e p h a r i s m a j a p o n i c u m) 、より好ましくは配列番号 9 によって定義される H P P D をコードする配列番号 8 と同一の D N A 配列を含むもの、(e) ロドコッカス(R h o d o c o c c u s) 、好ましくはロドコッカス(R h o d o c o c c u s) 属種(R H A 1 株) 、分離株 r o 0 3 0 4 1 、より好ましくは配列番号 1 1 によって定義される H P P D をコードする配列番号 1 0 と同一の D N A 配列またはロドコッカス(R h o d o c o c c u s) 属種(R H A 1 株) 、分離株 r o 0 2 0 4 0 、より好ましくは配列番号 1 3 によって定義される H P P D をコードする配列番号 1 2 と同一の D N A 配列を含むもの、(f) ピクロフィルス科(P i c r o p h i l a c e a e) 、好ましくはピクロフィルス・トリズス(P i c r o p h i l u s t o r r i d u s) 、より好ましくは配列番号 1 5 によって定義される H P P D をコードする配列番号 1 4 と同一の D N A 配列を含むもの、(g) コルディア(K o r d i a) 、好ましくはコルディア・アルギシダ(K o r d i a a l g i c i d a) 、より好ましくは配列番号 1 7 によって定義される H P P D をコードする

10

20

30

40

50

配列番号 16 と同一の DNA 配列を含むものからなる生物の群の 1 構成員由来の HPPD をコードし、または (II) 前記で定義の生物の HPPD をコードする遺伝子の突然変異核酸配列によってコードされた HPPD、好ましくは WO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、または PCT/EP2010/070575 に記載の突然変異体を表す少なくとも一つの核酸配列を含む使用に関するものである。

【0072】

別の特定の実施形態において、本発明は、前記で記載のキメラ遺伝子を含むトランスジェニック植物における上記で定義の N - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくは N - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩の使用であって、(I) (a) カラスムギ属、好ましくはカラスムギ (*Avena sativa*)、より好ましくは配列番号 2 によって定義される HPPD をコードする配列番号 1 と同一の DNA 配列を含むもの、(b) シュードモナス (*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌 (*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号 4 によって定義される HPPD をコードする配列番号 3 と同一の DNA 配列を含むもの、(c) シネコッコイデアエ (*Synechococcoideae*)、好ましくはシネコッカス (*Synechococcus*) 属種、より好ましくは配列番号 7 によって定義される HPPD をコードする配列番号 6 と同一の DNA 配列を含むもの、(d) アミカ (*Blepharisma midiae*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム (*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号 9 によって定義される HPPD をコードする配列番号 8 と同一の DNA 配列を含むもの、(e) ロドコッカス (*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス (*Rhodococcus*) 属種 (*RHA* 1 株)、分離株 r003041、より好ましくは配列番号 11 によって定義される HPPD をコードする配列番号 10 と同一の DNA 配列またはロドコッカス (*Rhodococcus*) 属種 (*RHA* 1 株)、分離株 r002040、より好ましくは配列番号 13 によって定義される HPPD をコードする配列番号 12 と同一の DNA 配列を含むもの、(f) ピクロフィルス科 (*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス (*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号 15 によって定義される HPPD をコードする配列番号 14 と同一の DNA 配列を含むもの、(g) コルディア (*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ (*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号 17 によって定義される HPPD をコードする配列番号 16 と同一の DNA 配列を含むものからなる生物の群の 1 構成員由来の、または (II) 前記で定義の生物の HPPD をコードする遺伝子の突然変異核酸配列、好ましくは WO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、または PCT/EP2010/070575 に記載の突然変異体によってコードされたヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ (HPPD) をコードする核酸配列の 5 位において、キメラ遺伝子が植物輸送ペプチドをコードする核酸配列を含み、この配列が、プロモーター領域と、(I) (a) カラスムギ属、好ましくはカラスムギ (*Avena sativa*)、より好ましくは配列番号 2 によって定義される HPPD をコードする配列番号 1 と同一の DNA 配列を含むもの、(b) シュードモナス (*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌 (*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号 4 によって定義される HPPD をコードする配列番号 3 と同一の DNA 配列を含むもの、(c) シネコッコイデアエ (*Synechococcoideae*)、好ましくはシネコッカス (*Synechococcus*) 属種、より好ましくは配列番号 7 によって定義される HPPD をコードする配列番号 6 と同一の DNA 配列を含むもの、(d) アミカ (*Blepharisma midiae*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム (*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号 9 によって 40

定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来の、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の突然変異核酸配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体によってコードされたヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードする核酸配列との間に配置されていることで、輸送ペプチド/HPPD融合タンパク質の発現を可能とする使用に関するものである。10
20

【0073】

さらに別の特定の実施形態において、本発明は、(I)(a)カラスマギ属、好ましくはカラスマギ(*Avenasativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(*Blepharisma*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードするDNA配列を含み、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含むものを含む1以上のキメラ遺伝子を含む植物、植30
40
50

物部分または植物種子における上記で定義のN - (テトラゾール-4-イル) - もしくはN - (トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの使用、またはそのような植物、植物部分もしくは種子が成長すべきまたは蒔かれるべき土壤での単独でまたはHPPD阻害薬とは異なる形で作用する1以上の他の公知の除草剤と組み合わせての上記で定義のN - (テトラゾール-4-イル) - もしくはN - (トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩の使用に関するものである。

【0074】

さらに別の特定の実施形態では、トリケトン類(トリケトンHPPD阻害剤と呼ぶ)、例えば、テンボトリオン、スルコトリオン、メソトリオン、ビシクロピロン、テフリルトリオン、特にはテンボトリオン、ジケトン類、例えば、ジケトニトリル、イソオキサゾール類、例えば、イソキサフルトール、またはピラゾリネット類(ピラゾリネットHPPD阻害剤と呼ぶ)、例えば、ピラスルホトール、ピラゾレート、トプラメゾン、ベンゾフェナップからなる群から選択されるHPPD阻害薬型除草剤との混合物で、同時にもしくは順次にて上記で定義のN - (テトラゾール-4-イル) - もしくはN - (トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩除草剤を施用することができ、さらにより具体的には、本発明は、(I)(a)カラスマギ属、好ましくはカラスマギ(*Avena sativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ(*Synechococcus deae*)、好ましくはシネココッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(*Blepharisma midae*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードするDNA配列を含み、または(I)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含む1以上のキメラ遺伝子を含むそのようなHPPD阻害薬耐性植物、植物部分もしくは植物種子へのテンボトリオン、メソトリオン、ジケトニトリル、ビシクロピロン、テフリルトリオン、ベンゾフェナップ、ピラスルホトール、ピラゾレートおよびスルコトリオンの施用に関するものである。

【0075】

植物細胞および植物でプロモーターとして機能する調節配列としては、植物で自然に発現される遺伝子のプロモーター配列、特には、植物の葉で特に発現されるプロモーター、

10

20

30

40

50

例えば、細菌、ウイルスまたは植物起源の「構成的」プロモーター、または「光依存性」プロモーター、例えば、植物のリブロース - ビスカルボキシラーゼ / オキシゲナーゼ (R u B i s C O) 小サブユニット遺伝子のプロモーター、または使用することができるいずれか好適な公知の発現可能なプロモーターを使用することができる。植物起源のプロモーターの中で、E P 0 5 0 7 6 9 8 A 1 に記載されているヒストンプロモーター、イネアクチンプロモーター (U S 5 , 6 4 1 , 8 7 6)、または植物のユビキチンプロモーター (U S 5 , 5 1 0 , 4 7 4) が挙げられる。植物ウイルス遺伝子のプロモーターの中で、カリフラワーモザイクウイルス (C a M V 1 9 S または 3 5 S, S a n d e r s e t a l . (1 9 8 7) , N u c l e i c A c i d s R e s . 1 5 (4) : 1 5 4 3 - 5 8)、サーコウイルス (A U 6 8 9 3 1 1)、またはキャッサバベインモザイクウィルス (C s V M V, U S 7 , 0 5 3 , 2 0 5) のプロモーターが挙げられる。

【0076】

さらに別の特定の実施形態では、本発明は、種子特異的なプロモーター (D a t l a , R . e t a l . , 1 9 9 7, B i o t e c h n o l o g y A n n . R e v . 3 , 2 6 9 - 2 9 6)、特に、n a p i n プロモーター (E P 2 5 5 3 7 8 A 1)、ファゼオリンプロモーター、グルテニンプロモーター、ヘリアンチニンプロモーター (W O 9 2 / 1 7 5 8 0)、アルブミンプロモーター (W O 9 8 / 4 5 4 6 0)、オレオシンプロモーター (W O 9 8 / 4 5 4 6 1)、S A T 1 プロモーターまたはS A T 3 プロモーター (P C T / U S 9 8 / 0 6 9 7 8)などの、(I)(a)カラスムギ属、好ましくはカラスムギ (A v e n a s a t i v a)、より好ましくは配列番号 2 によって定義されるH P P D をコードする配列番号 1 と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス (P s e u d o m o n a s)、好ましくは蛍光菌 (P s e u d o m o n a s f l u o r e s c e n s)、より好ましくは配列番号 4 によって定義されるH P P D をコードする配列番号 3 と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ (S y n e c h o c o c c o i d e a e)、好ましくはシネココッカス (S y n e c h o c o c c u s) 属種、より好ましくは配列番号 7 によって定義されるH P P D をコードする配列番号 6 と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ (B l e p h a r i s m i d a e)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム (B l e p h a r i s m a j a p o n i c u m)、より好ましくは配列番号 9 によって定義されるH P P D をコードする配列番号 8 と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス (R h o d o c o c c u s)、好ましくはロドコッカス (R h o d o c o c c u s) 属種 (R H A 1 株)、分離株 r o 0 3 0 4 1 、より好ましくは配列番号 1 1 によって定義されるH P P D をコードする配列番号 1 0 と同一のDNA配列またはロドコッカス (R h o d o c o c c u s) 属種 (R H A 1 株)、分離株 r o 0 2 0 4 0 、より好ましくは配列番号 1 3 によって定義されるH P P D をコードする配列番号 1 2 と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科 (P i c r o p h i l a c e a e)、好ましくはピクロフィルス・トリズス (P i c r o p h i l u s t o r r i d u s)、より好ましくは配列番号 1 5 によって定義されるH P P D をコードする配列番号 1 4 と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア (K o r d i a)、好ましくはコルディア・アルギシダ (K o r d i a a l g i c i d a)、より好ましくは配列番号 1 7 によって定義されるH P P D をコードする配列番号 1 6 と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来の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) をコードするDNA配列を含み、または(I I)前記で定義の生物のH P P D をコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはW O 2 0 1 0 / 0 8 5 7 0 5 、U S 6 , 2 4 5 , 9 6 8 、W O 2 0 0 9 / 1 4 4 0 7 9 、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 6 1 、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 6 7 、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 8 、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 0 、またはP C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 5 に記載の突然変異体を含む1以上のキメラ遺伝子を発現させるのに用いることができる植物の特定の領域もしくは組織に特異的なプロモーター配列を含む植物、植物部分もしくは植物種子に対する上記で定義のN - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくはN - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩の使用に関する

10

20

30

40

50

ものである。

【0077】

また、フェニルアラニンアンモニアリーゼ(P A L)、H M G - C o A レダクターゼ(H M G)、キチナーゼ、グルカナーゼ、プロティナーゼ阻害剤(P I)、P R 1 ファミリー遺伝子、ノパリンシンターゼ(n o s)およびv s p B プロモーター(U S 5 6 7 0 3 4 9 、表3)、H M G 2 プロモーター(U S 5 6 7 0 3 4 9)、リンゴ - ガラクトシダーゼ(A B G 1) プロモーターおよびリンゴアミノシクロプロパンカルボン酸シンターゼ(A C C シンターゼ) プロモーター(W O 9 8 / 4 5 4 4 5)から有利に選択される誘導プロモーターを使用することもできる。

【0078】

(I) (a) カラスムギ属、好ましくはカラスムギ(A v e n a s a t i v a)、より好ましくは配列番号2によって定義されるH P P Dをコードする配列番号1と同一のD N A配列を含むもの、(b) シュードモナス(P s e u d o m o n a s)、好ましくは蛍光菌(P s e u d o m o n a s f l u o r e s c e n s)、より好ましくは配列番号4によって定義されるH P P Dをコードする配列番号3と同一のD N A配列を含むもの、(c) シネココッコイデアエ(S y n e c h o c o c c o i d e a e)、好ましくはシネココッカス(S y n e c h o c o c c u s)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるH P P Dをコードする配列番号6と同一のD N A配列を含むもの、(d) アミカ(B l e p h a r i s m i d a e)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム(B l e p h a r i s m a j a p o n i c u m)、より好ましくは配列番号9によって定義されるH P P Dをコードする配列番号8と同一のD N A配列を含むもの、(e) ロドコッカス(R h o d o c o c c u s)、好ましくはロドコッカス(R h o d o c o c c u s)属種(R H A 1 株)、分離株r o 0 3 0 4 1 、より好ましくは配列番号11によって定義されるH P P Dをコードする配列番号10と同一のD N A配列またはロドコッカス(R h o d o c o c c u s)属種(R H A 1 株)、分離株r o 0 2 0 4 0 、より好ましくは配列番号13によって定義されるH P P Dをコードする配列番号12と同一のD N A配列を含むもの、(f) ピクロフィルス科(P i c r o p h i l a c e a e)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(P i c r o p h i l u s t o r r i d u s)、より好ましくは配列番号15によって定義されるH P P Dをコードする配列番号14と同一のD N A配列を含むもの、(g) コルディア(K o r d i a)、好ましくはコルディア・アルギシダ(K o r d i a a l g i c i d a)、より好ましくは配列番号17によって定義されるH P P Dをコードする配列番号16と同一のD N A配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来の、または(I I) 前記で定義の生物のH P P Dをコードする遺伝子の突然変異D N A配列によって表される、好ましくはW O 2 0 1 0 / 0 8 5 7 0 5 、U S 6 , 2 4 5 , 9 6 8 、W O 2 0 0 9 / 1 4 4 0 7 9 、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 6 1 、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 6 7 、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 8 、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 0 、またはP C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 5 に記載の突然変異体によって表されるヒドロキシフェニルビルビン酸ジオキシゲナーゼ(H P P D)をコードする遺伝子を、プロモーターとコード配列間に位置している他の調節配列、例えば、転写アクチベーター(「エンハンサー」)、例えば、特許出願W O 8 7 / 0 7 6 4 4 に記載のタバコモザイクウイルス(T M V)の翻訳アクチベーター、または、例えばC a r r i n g t o n & F r e e d 1 9 9 0 , J . V i r o l . 6 4 : 1 5 9 0 - 1 5 9 7 に記載のタバコエッチウイルス(T E V)の翻訳アクチベーター、またはトウモロコシのa d h 1 イントロンもしくはイネアクチンのイントロン1などのイントロンを、プロモーターと組み合わせて使用して、上記で定義のN - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくはN - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩に対する十分な耐性を発揮させることもできる。

【0079】

別の特定の実施形態において本発明は、上記で定義のN - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくはN - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類もしくはそれらの

10

20

30

40

50

塩に対する耐性を与えるための、(I)(a)カラスムギ属、好ましくはカラスムギ(*Avena sativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ(*Synechococcoidaeae*)、好ましくはシネココッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(*Blepharisma midae*)、好ましくはブレファリスマ・ジャボニクム(*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルビルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードするDNA配列を含み、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含む1以上のキメラ遺伝子を含み、さらには同一もしくは異なる植物発現可能プロモーターの制御下にあるCYP450トウモロコシモノオキシゲナーゼ(ns f1遺伝子)を含む植物、植物部分もしくは植物種子への上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩の使用に関するものである。

【0080】

調節ターミネータまたはポリアデニル化配列としては、細菌起源の相当する配列、例えばアグロバクテリウム・ツメファシエンス(*Agrobacterium tumefaciens*)のnosターミネータなど、ウイルス起源の相当する配列、例えば、CaMV35Sターミネータなど、または植物起源の相当する配列、例えば、公開特許出願EP0633317A1に記載されるヒストンターミネータなどを使用することができる。

【0081】

理解すべき点として、個々のキメラ遺伝子の宿主適応したコドン使用による至適な発現を得るためにには、そのようなキメラ遺伝子を挿入する個々の植物生命体のコドン使用に対して非植物遺伝子を採用することができるものと考えられる。従って、非植物起源のHPPDを発現する記載のキメラ遺伝子の全てにおいて、個々のHPPDコードDNA配列を、同一のアミノ酸配列をコードする修正DNA配列によって置き換えることができる。すなわち、配列番号3を配列番号5によって置き換えることができ、配列番号6を配列番号18によって置き換えることができ、配列番号8を配列番号19によって置き換えることができ、配列番号10を配列番号20によって置き換えることができ、配列番号12を配列番号21によって置き換えることができ、配列番号14を配列番号22によって置き換えることができ、配列番号16を配列番号23によって置き換えることができる。

10

20

30

40

50

【0082】

本明細書で使用される場合の「遺伝子」という用語は、代表的には、少なくともプロモーター領域を含む、タンパク質に翻訳することができるRNAを転写可能とする5および/または3調節配列が隣接するDNAコード領域を指す。「キメラ遺伝子」は、HPPDコードDNAに関する場合、そのネイティブ宿主細胞においてHPPDタンパク質の発現を駆動する、天然の細菌の5および/または3調節配列とは異なる5および/または3調節配列を有するHPPDコードDNA配列を指す（「異種プロモーター」または「異種調節配列」とも称される）。

【0083】

本明細書で使用される場合の「配列Xを含むDNA/タンパク質」および「配列Xを含む配列を有するDNA/タンパク質」という用語は、他のヌクレオチドまたはアミノ酸配列が、5（またはN末端）末端および/または3（またはC末端）末端に含まれ得るよう（例えば、N末端輸送またはシグナルペプチド）、そのヌクレオチドまたはアミノ酸配列に少なくとも配列Xを含むまたは含有するDNAまたはタンパク質を指す。本明細書で使用される場合の「含む（comprising）」という用語は、「含む（including）」の意味で非制限的な言葉であり、具体的に列挙される以外の他の要素も存在し得ることを意味する。本明細書で使用される場合の「からなる（consisting of）」という用語は、限定的な言葉であり、すなわち、具体的に列挙される要素のみが存在する。本明細書で使用される場合の「配列Xを含むタンパク質をコードするDNA」という用語は、転写および翻訳後に、少なくともアミノ酸配列Xを含有するタンパク質を生じるコード配列を含むDNAを指す。タンパク質をコードするDNAは天然のDNAである必要はなく、半合成、完全合成または人工DNAであってもよく、そして、イントロンおよび5および/または3隣接領域を含むことができる。本明細書で使用される場合の「ヌクレオチド配列」という用語は、一本鎖または二本鎖形態であることができるDNAまたはRNA分子の配列を指す。

【0084】

本発明によるHPPDタンパク質は、当技術分野で公知の手順（例えば、公開PCT特許出願WO 96/10083を参照）に従ってシグナルペプチドを備えていてもよく、または別のペプチド、例えば、当該タンパク質を葉緑体に輸送する葉緑体輸送ペプチド（例えば、Van Den Broeck et al., 1985, Nature 313, 358、または米国特許第5,510,471号の改変葉緑体輸送ペプチド）、分泌シグナルペプチド、または当該タンパク質を他の色素体、ミトコンドリア、ERもしくは別の細胞小器官に標的化するペプチドで置換されていてもよく、またはメチオニンアミノ酸またはメチオニン-アラニンジペプチドで置き換わっていても良い。細胞内小器官を標的とするまたは植物細胞外または細胞壁へ分泌するシグナル配列、好ましくは、Klosgenら(1989, Mol. Gen. Genet. 217, 155-161)、KlosgenおよびWeil(1991, Mol. Gen. Genet. 225, 297-304)、Neuhaus & Rogers(1998, Plant Mol. Biol. 38, 127-144)、Bihら(1999, J. Biol. Chem. 274, 22884-22894)、Morrissら(1999, Biochem. Biophys. Res. Commun. 255, 328-333)、Hesseら(1989, EMBO J. 8 2453-2461)、Tavladorakiら(1998, FEBS Lett. 426, 62-66)、Terashimaら(1999, Appl. Microbiol. Biotechnol. 52, 516-523)、Parkら(1997, J. Biol. Chem. 272, 6876-6881)、Shcherbanら(1995, Proc. Natl. Acad. Sci. USA 92, 9245-9249)（これらの全てが参考により本明細書に組み込まれる）により記載されるシグナル配列、特に、トウモロコシ、ワタ、ダイズまたはイネの標的または分泌タンパク質由来のシグナルペプチド配列が、天然の標的または分泌タンパク質に見出されている。そのような植物シグナ

10

20

30

40

50

ルペプチドをコードするDNA配列は、植物で発現するためにHPPDタンパク質をコードするキメラ遺伝子内に挿入することができる。

【0085】

本発明はまた、前記の1以上のアミノ酸のそれぞれにおいて挿入、欠失または置換されている配列番号2、配列番号4、配列番号7、配列番号9、配列番号11、配列番号13、配列番号15および配列番号17のHPPDアミノ酸配列と同様のアミノ酸配列である変異HPPD酵素も包含する。本発明の文脈において、アミノ酸配列の変異体とは、アミノ酸の置換、付加もしくは欠失があったとしても本明細書に記載のアミノ酸配列と同様の触媒活性を有するポリペプチド、酵素もしくはタンパク質を指すものである。好ましくは変異アミノ酸配列は、配列番号2、配列番号4、配列番号7、配列番号9、配列番号11、配列番号13、配列番号15および配列番号17のアミノ酸配列とそれぞれ少なくとも約80%、または85%もしくは90%、95%、97%、98%もしくは99%の配列同一性を有する。やはり好ましくは、変異アミノ酸配列を含むポリペプチドは、HPPD酵素活性を有する。HPPD酵素活性を求める方法は当業界で公知であり、それにはWO 2009/144079もしくはWO 2002/046387、またはPCT/EP2010/070561で広く記載されているアッセイなどがある。10

【0086】

置換は、アミノ酸が異なる天然または非従来的アミノ酸残基で置き換わっているアミノ酸変化を包含する。そのような置換は、本発明のHPPDタンパク質に含有されるアミノ酸残基が類似の性質の別の天然アミノ酸で置き換わっている「保存的」に分類することができ、例えば、Gly Ala、Val Ile Leu、Asp Glu、Lys Arg、Asn GlnまたはPhe Trp Tyrである。本発明により包含される置換は、また、本発明のHPPDタンパク質に存在するアミノ酸残基が、異なる性質のアミノ酸、例えば、異なるグループの天然アミノ酸で置換されている（例えば、荷電または疎水性アミノ酸をアラニンで置換する）「非保存的」であってもよい。アミノ酸置換は、代表的には、単一残基の置換であるが、集合または分散した複数の残基のものであってもよい。アミノ酸の欠失は、通常、約1から10個程度のアミノ酸残基のものであるが、一方で、挿入はいずれの長さが挿入されてもよい。欠失および挿入は、N末端、C末端で起こってもよく、内部の欠失または挿入でもよい。一般的に、アミノ酸配列内の挿入は、アミノまたはカルボキシ末端融合よりも小さく、1から4個程度のアミノ酸残基の挿入である。20
。本明細書で使用される場合の「類似アミノ酸」は、類似のアミノ酸側鎖を有するアミノ酸、すなわち、極性、非極性または実質的に中性の側鎖を有するアミノ酸を指す。本明細書で使用される場合の「非類似アミノ酸」は、異なるアミノ酸側鎖を有するアミノ酸を指し、例えば、極性側鎖を有するアミノ酸は、非極性側鎖を有するアミノ酸と非類似である。30
。極性側鎖は、通常、細胞内で認められる水性環境と相互作用することができる、タンパク質の表面に存在する傾向がある（「親水性」アミノ酸）。他方、「非極性」アミノ酸は、類似の非極性の隣接物と相互作用することができるタンパク質の中心内部に存在する傾向がある（「疎水性」アミノ酸）。極性側鎖を有するアミノ酸の例は、アルギニン、アスパラギン、アスパラギン酸、システイン、グルタミン、グルタミン酸、ヒスチジン、リジン、セリンおよびトレオニンである（疎水性であるシステインを除いて、いずれも親水性）。40
。非極性側鎖を有するアミノ酸の例は、アラニン、グリシン、イソロイシン、ロイシン、メチオニン、フェニルアラニン、プロリンおよびトリプトファンである（中性であるグリシンを除いて、いずれも疎水性）。

【0087】

例示において別段の断りがない限り、組換えDNAを製造および操作する手順はいずれも、Sambrook et al., Molecular Cloning - A Laboratory Manual, Second Ed., Cold Spring Harbor Laboratory Press, NY (1989)およびAusubel et al. (1994) Current Protocols in Molecular Biology, Current Protocols,50

U S A の 1 巻および 2 巻に記載の標準的手順により実施される。植物分子生物学研究の標準的な材料および方法が、R. R. D. C r o y による P l a n t M o l e c u l a r B i o l o g y L a b f a x (1 9 9 3) (B I O S S c i e n t i f i c P u b l i c a t i o n s L t d (U K) および B l a c k w e l l S c i e n t i f i c P u b l i c a t i o n s (U K) による共同出版) に記載されている。P C R 技術の手順は、P C R p r o t o c o l s : a g u i d e t o m e t h o d s a n d a p p l i c a t i o n s , E d i t e d b y M . A . I n n i s , D . H . G e l f a n d , J . J . S n i n s k y a n d T . J . W h i t e (A c a d e m i c P r e s s , I n c . , 1 9 9 0) に記載されている。

10

【 0 0 8 8 】

「耐性(tolerance)」、「耐性がある(tolerant)」または「低感受性」という用語は互換的に使用され、異なる濃度の各種H P P D 阻害薬型除草剤の存在下で、各H P P D タンパク質をコードする遺伝子を含む核酸で形質転換した菌株または植物の肉眼観察可能な指標表現型によってスクリーニングされる、H P P D の内在的耐性の相対レベルを意味する。これらの指標表現型(褐色の呈色、増殖阻害、白化、除草効果など)と関連する用量応答および用量応答における相対的シフトは、従来より、広範囲の異なる除草剤濃度での、植物の損傷、分裂組織の白化症状などに基づく通常の方法で、例えば、G R 5 0 (生育を 5 0 % 減少させる濃度) または M I C (最小発育阻止濃度) 値によって表され、ここで、値の増加は、発現されたH P P D の内在的耐性の増加に相当する。これらのデータは、例えば、x 軸にプロットされる「用量」と y 軸にプロットされた「死滅パーセント」、「除草効果」、「緑色植物の発芽数」などを有する用量 / 応答曲線から誘導される G R 5 0 値によって表すことができ、ここで、G R 5 0 値の増加は、発現されたH P P D の内在的耐性レベルの増加に相当する。除草剤は好適には、発芽前または出芽後に施用することができる。

20

【 0 0 8 9 】

同様に、耐性レベルは、タバコなどの試験植物、またはダイズもしくはワタなどの作物の遺伝子組換え、再生、育種および散布試験を介してスクリーニングされ、これらの結果に従って、そのような植物は、上記で定義の N - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくは N - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩のような H P P D 阻害薬型除草剤に対して、H P P D タンパク質をコードする外来遺伝子を全く含有しない植物と比較して少なくとも 2 から 4 倍耐性が高い。

30

【 0 0 9 0 】

「宿主生物」または「宿主」は、H P P D を産生する目的のために本発明による核酸またはキメラ遺伝子を導入することができる単細胞または多細胞異種生物であると理解される。これらの生物は、特に、細菌、例えば、大腸菌、酵母、特に、サッカロミセス(S a c c h a r o m y c e s) 属またはクリベロミセス(K l u y v e r o m y c e s) 属、ピチア(P i c h i a) 属、真菌、特に、アスペルギルス(A s p e r g i l l u s) 属、バキュロウイルス、または、好ましくは、植物細胞および植物である。

40

【 0 0 9 1 】

「植物細胞」は、本発明によれば、植物に由来または見出され、カルスなどの未分化組織、胚、植物の部分、植物もしくは種子などの分化組織を生成することができるか、またはその一部である細胞であると理解される。これは、プロトプラストおよび花粉、培養植物細胞またはイン・ビトロで成長したプロトプラストならびに完全な植物に再生することができる植物細胞を含む。

【 0 0 9 2 】

「植物」は、本発明によれば、光合成することができる分化多細胞生物、特に、单子葉植物または双子葉植物、とりわけ、動物またはヒトの栄養を意図するまたは意図しない栽培植物、例えば、トウモロコシまたはコーン、コムギ、アブラナ(B r a s s i c a) 属種植物、例えば、ブロッサム・ナップス(B r a s s i c a n a p u s) またはブロッサム

50

カ・ジュンセア (*Brassica juncea*)、ダイズ類、イネ、サトウキビ、ピート根、タバコ、ワタ、野菜植物、例えば、キュウリ、リーキ、ニンジン、トマト、レタス、コショウ、メロン、スイカなどであると理解される。トランスジェニック植物は、本明細書で使用される場合、ゲノムに安定に挿入された1以上の外来または異種遺伝子を含む植物を指す。

【0093】

上記で定義のN - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくはN - (トリアゾール - 3 - イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩に対する耐性を発揮するため、植物で自然に発現される遺伝子のプロモーター配列、またはアグロバクテリウム属 (*Agrobacterium*) または植物ウイルスプロモーターなどの植物で自然に発現される遺伝子のプロモーター要素のハイブリッドもしくは組み合わせ、または植物の除草剤耐性遺伝子の転写の制御に好適なプロモーター(本明細書において、「植物で発現可能なプロモーター」と呼ぶ)を、本発明の植物において、プロモーター配列として使用することができる。そのような好適な植物で発現可能なプロモーターの例は上述されている。本発明の1実施形態では、そのような植物で発現可能なプロモーターが、(I)(a)カラスムギ属、好ましくはカラスムギ (*Avena sativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シユードモナス (*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌 (*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ (*Synechococcoideae*)、好ましくはシネココッカス (*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ (*Blepharismaidae*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム (*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス (*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス (*Rhodococcus*)属種 (RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス (*Rhodococcus*)属種 (RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科 (*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス (*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア (*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ (*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルビルビン酸ジオキシゲナーゼ (HPPD)をコードするDNA配列、または(II)前記で定義の生物のHPPDの突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、U.S.6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然DNA配列に操作可能に連結され、包含もする。

【0094】

本発明によれば、プロモーター調節配列と組み合わせて、プロモーターとコード配列との間に位置している他の調節配列、例えば、イントロン配列、または転写アクチベーター(エンハンサー)を使用して、上記で定義のN - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくはN - (トリアゾール - 3 - イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩に対する耐性を発揮することも可能である。そのような好適な調節配列の例は上述されている。

【0095】

10

20

30

40

50

細菌またはウイルス起源の相当する配列、例えば、アグロバクテリウム・ツメファシエンス (*Agrobacterium tumefaciens*) 由来のnosターミネータ、または植物起源のもの、例えば特許出願EP0633317A1に記載されるヒストンターミネータなどを転写終結(およびポリアデニル化)調節配列として使用することができる。

【0096】

さらに別の特定の実施形態において本発明は、輸送ペプチド-HPPD融合タンパク質の発現を可能とするための、(I)(a)カラスマギ属、好ましくはカラスマギ(*Avenasativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ(*Synechococcoideae*)、好ましくはシネココッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(*Blepharismaidae*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードするDNA配列を含み、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含む外因性キメラ遺伝子をコードする核酸配列の5(上流)で用いられる輸送ペプチドをコードする核酸配列を含み、さらにはこの輸送ペプチド配列がプロモーター領域と外因性HPPDをコードする配列との間に配置されている植物、植物部分もしくは植物種子への上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩の使用に関するものである。輸送ペプチドにより、HPPDを色素体、特に、葉緑体に移動させることが可能となり、融合タンパク質は色素体にHPPDタンパク質が導入されたときに輸送ペプチドとHPPDタンパク質間で開裂される。輸送ペプチドは、単一ペプチド、例えば、EPSPS輸送ペプチド(米国特許第5,188,642号に記載)または植物のリブロースニリン酸カルボキシラーゼ/オキシゲナーゼ小サブユニット(*Rubisco ssu*)の輸送ペプチド(適切な場合は、成熟*Rubisco ssu*のN末端部分の数個のアミノ酸を含む(EP189707A1))であってもよく、またはいくつかの輸送ペプチドの融合物、例えば、特許第EP508909A1号に記載されている、色素体位置を有する成熟タンパク質のN末端配列の一部に融合した第一の植物輸送ペプチドと、この一部分に融合している第二の植物輸送ペプチドを含む輸送ペプチドであってもよく、そして、より具体的

10

20

30

40

50

的には、トウモロコシ R u B i s C O s s u の N 末端の 2 2 個のアミノ酸に融合し、そしてトウモロコシ R u B i s C O s s u の輸送ペプチドに融合しているヒマワリ R u B i s C O s s u の輸送ペプチドを含む最適化された輸送ペプチドであってもよい（特許第 E P 5 0 8 9 0 9 A 1 号においてそのコード配列と共に記載されている）。

【 0 0 9 7 】

本発明は、また、輸送ペプチド H P P D 融合タンパク質およびそのような融合タンパク質をコードする核酸または植物で発現可能なキメラ遺伝子に関するものであり、この融合タンパク質の 2 つの要素は上記で定義されている。

【 0 0 9 8 】

さらに別の特定の実施形態において、本発明は、クローニング、発現ベクターによる形質転換によって得られる植物、植物部分もしくは植物種子での上記で定義の N - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくは N - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩の使用であって、発現ベクターが (a) カラスムギ属、好ましくはカラスムギ (*A v e n a s a t i v a*) 、より好ましくは配列番号 2 によって定義される H P P D をコードする配列番号 1 と同一の DNA 配列を含むもの、 (b) シュードモナス (*P s e u d o m o n a s*) 、好ましくは蛍光菌 (*P s e u d o m o n a s f l u o r e s c e n s*) 、より好ましくは配列番号 4 によって定義される H P P D をコードする配列番号 3 と同一の DNA 配列を含むもの、 (c) シネココッコイデアエ (*S y n e c h o c o c c o i d e a e*) 、好ましくはシネココッカス (*S y n e c h o c o c c u s*) 属種、より好ましくは配列番号 7 によって定義される H P P D をコードする配列番号 6 と同一の DNA 配列を含むもの、 (d) アミカ (*B l e p h a r i s m i d a e*) 、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム (*B l e p h a r i s m a j a p o n i c u m*) 、より好ましくは配列番号 9 によって定義される H P P D をコードする配列番号 8 と同一の DNA 配列を含むもの、 (e) ロドコッカス (*R h o d o c o c c u s*) 、好ましくはロドコッカス (*R h o d o c o c c u s*) 属種 (R H A 1 株) 、分離株 r o 0 3 0 4 1 、より好ましくは配列番号 1 1 によって定義される H P P D をコードする配列番号 1 0 と同一の DNA 配列またはロドコッカス (*R h o d o c o c c u s*) 属種 (R H A 1 株) 、分離株 r o 0 2 0 4 0 、より好ましくは配列番号 1 3 によって定義される H P P D をコードする配列番号 1 2 と同一の DNA 配列を含むもの、 (f) ピクロフィルス科 (*P i c r o p h i l a c e a e*) 、好ましくはピクロフィルス・トリズス (*P i c r o p h i l u s t o r r i d u s*) 、より好ましくは配列番号 1 5 によって定義される H P P D をコードする配列番号 1 4 と同一の DNA 配列を含むもの、 (g) コルディア (*K o r d i a*) 、好ましくはコルディア・アルギシダ (*K o r d i a a l g i c i d a*) 、より好ましくは配列番号 1 7 によって定義される H P P D をコードする配列番号 1 6 と同一の DNA 配列を含むものからなる生物の群の 1 構成員由来の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) をコードし、または (I I) 前記で定義の生物の H P P D をコードする遺伝子の 1 以上の突然変異 DNA 配列、好ましくは WO 2 0 1 0 / 0 8 5 7 0 5 、 U S 6 , 2 4 5 , 9 6 8 、 WO 2 0 0 9 / 1 4 4 0 7 9 、 P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 6 1 、 P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 6 7 、 P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 8 、 P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 0 、または P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 5 に記載の突然変異体を含む少なくとも一つのキメラ遺伝子を含む使用に関するものである。上記キメラ遺伝子の他に、このベクターは複製起点を含むことができる。このベクターは、本発明によるキメラ遺伝子を導入することにより形質転換されたプラスミドもしくはプラスミドの部分、コスミドまたはバクテリオファージもしくはウイルスであることができる。形質転換ベクターは当業者によく知られており、文献に広く記載されている。特に、植物細胞または植物の形質転換に使用することができる形質転換ベクターは、植物細胞または植物の形質転換に用いることができ、自己の複製および発現要素をさらに含むウイルスであることができる。植物細胞または植物を形質転換するためのベクターは、好ましくは、プラスミド、例えば、不活化アグロバクテリウム (*A g r o b a c t e r i u m*) Ti プラスミドである。

10

20

30

40

50

【0099】

さらに別の実施形態において、本発明は、(a)カラスムギ属、好ましくはカラスムギ(*Avena sativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネコッコイデアエ(*Synechococcus coideae*)、好ましくはシネコッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(*Blepharisma midae*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードし、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含む配列を含むキメラ遺伝子を含む植物、植物部分もしくは植物種子における上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩の使用、ならびに農地における、作物を成長させ、植物生産物、例えば、ダイズ類、イネ、コムギ、オオムギもしくはトウモロコシ穀粒またはワタボールを収穫するまでの植物または種子の使用であって、1実施態様において、当該使用が、雑草を防除するための上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩のそのような植物への施用を含む使用に関するものである。

【0100】

別の特定の実施形態において、本発明は、植物、植物部分もしくは植物種子における上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩の使用であって、その対象物が(I)(a)カラスムギ属、好ましくはカラスムギ(*Avena sativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネコッコイデアエ(*Synechococcus coideae*)、好ましくはシネコッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(*Blepharisma midae*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)

japonicum)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードするDNA配列を含み、または(I)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含む1以上のキメラ遺伝子を含み、その上さらに、上記の植物発現可能プロモーターを含み、PDH(プレフェン酸デヒドロゲナーゼ)酵素(US2005/0257283)をコードする核酸配列に操作可能に連結されているキメラ遺伝子を含むことで、上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩に対する耐性を与えることを特徴とする使用に関するものである。そのような2つの導入遺伝子を含む植物は、当技術分野でよく知られているように、植物を一つの導入遺伝子で形質転換し、次に、このトランスジェニック植物を第二の導入遺伝子で再度形質転換することによるか、または植物を二つの導入遺伝子で同時に形質転換する(同じまたは二つの異なる形質転換DNAまたはベクターで)ことによるか、または第一の導入遺伝子を含む植物を、第二の導入遺伝子を含む植物と交配させることにより得ることができる。

【0101】

(I)(a)カラスマギ属、好ましくはカラスマギ(*Avenasativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネコッコイデアエ(*Synechococcoideae*)、好ましくはシネコッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(*Blepharisma*)、好ましくはブレファリストマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの

、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由來のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードするDNA配列を含み、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含む1以上のキメラ遺伝子を含むことで上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩に対して耐性である植物、植物部分もしくは種子を得るための一つの形質転換方法は、DNAが付着したまたはDNAを含有する固体または液体粒子を、細胞、プロトプラストまたは組織に衝突させることを含む。別の形質転換方法は、植物に導入する手段として、アグロバクテリウム・ツメファシエンス(*Agrobacterium tumefaciens*)Tiプラスミドまたはアグロバクテリウム・リゾゲネス(*Agrobacterium rhizogenes*)Riプラスミドに挿入されたキメラ遺伝子を使用することを含む。マイクロインジェクションまたはエレクトロポレーション、またはPEGを用いる直接遺伝子導入などの他の方法を使用してもよい。当業者であれば、選択の宿主生物、特に、植物細胞または植物を形質転換する適切な方法を選択することができる。例として、ダイズの形質転換技術がEP1186666A1に開示の実施例1から3に詳しく記載されており、これは参照により本明細書に組み込まれる。イネの場合では、アグロバクテリウム(*Agrobacterium*)介在の形質転換(Hiei et al., 1994 Plant J. 6:271-282およびHiei et al., 1997 Plant Mol. Biol. 35:205-21、これは参照により本明細書に組み込まれる)、エレクトロポレーション(US5,641,664およびUS5,679,558、これは参照により本明細書に組み込まれる)、または衝突(Christou et al., 1991, Biotechnology 9:957、これは参照により本明細書に組み込まれる)を実施することができると考えられる。単子葉植物、特に、イネの形質転換の好適な技術は、WO92/09696に記載されており、これは参照により本明細書に組み込まれる。ワタの場合では、アグロバクテリウム(*Agrobacterium*)介在の形質転換(Gould J. H. and Magallanes-Cedeno M., 1998 Plant Molecular Biology reporter, 16:1-10およびZapata C., 1999, Theoretical Applied Genetics, 98(2):1432-2242、これらは参照により本明細書に組み込まれる)、ポリブレンおよび/または処理介在の形質転換(Sawahel W. A., 2001, -Plant Molecular Biology reporter, 19:377a-377f、これは参照により本明細書に組み込まれる)が記載されている。

【0102】

あるいは、HPPDが、色素体、例えば葉緑体ゲノムの形質転換を用いて、色素体、例えば葉緑体で直接発現される、(I)(a)カラスマギ属、好ましくはカラスマギ(*Avenasativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ(*Synechococcoidae*)、好ましくはシネココッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(*Blepharismaidae*)、好ましくはブレファリスマ

・ジャボニクム (*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス (*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス (*Rhodococcus*)属種 (*RHA*1株)、分離株ro03041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス (*Rhodococcus*)属種 (*RHA*1株)、分離株ro02040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科 (*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス (*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア (*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ (*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由來のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ (HPPD) をコードするDNA配列を含み、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含む1以上のキメラ遺伝子を含む植物、植物部分もしくは植物種子において、上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩を用いることができる。好適な方法は、DNAでコーティングされた固体粒子またはDNAを含む液体粒子による植物細胞または組織の衝突、および相同意的組換えによる導入遺伝子の組み込みを含む。好適なベクターおよび選択システムは当業者に公知である。タバコ植物の葉緑体ゲノムへのそのような組み込みに使用することができる手段および方法の例が、WO06/108830に提供されており、この内容は参照により本明細書に組み込まれる。

【0103】

本発明はまた、上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩に対して耐性である植物を得る方法であって、その植物が(I)(a)カラスマギ属、好ましくはカラスマギ (*Avenasativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス (*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌 (*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ (*Synechococcoidae*)、好ましくはシネココッカス (*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ (*Blepharismidiae*)、好ましくはブレファリスマ・ジャボニクム (*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス (*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス (*Rhodococcus*)属種 (*RHA*1株)、分離株ro03041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス (*Rhodococcus*)属種 (*RHA*1株)、分離株ro02040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科 (*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス (*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア (*Kordia*)、好ましくはコル

10

20

30

40

50

ディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号 17 によって定義される HPPD をコードする配列番号 16 と同一の DNA 配列を含むものからなる生物の群の 1 構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードする DNA 配列を含み、または(I I)前記で定義の生物の HPPD をコードする遺伝子の 1 以上の突然変異 DNA 配列、好ましくは WO 2010 / 085705 、 U S 6 , 245 , 968 、 WO 2009 / 144079 、 PCT / EP 2010 / 070561 、 PCT / EP 2010 / 070567 、 PCT / EP 2010 / 070578 、 PCT / EP 2010 / 070570 、または PCT / EP 2010 / 070575 に記載の突然変異体を含む 1 以上のキメラ遺伝子によって形質転換されることを特徴とする方法に関するものである。

10

【 0104 】

従って、本発明は、(I)(a)カラスムギ属、好ましくはカラスムギ(*Avena sativa*)、より好ましくは配列番号 2 によって定義される HPPD をコードする配列番号 1 と同一の DNA 配列を含むもの、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号 4 によって定義される HPPD をコードする配列番号 3 と同一の DNA 配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ(*Synechococcoidae*)、好ましくはシネココッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号 7 によって定義される HPPD をコードする配列番号 6 と同一の DNA 配列を含むもの、(d)アミカ(*Blepharisma*)、好ましくはブレファリスマ・ジャボニクム(*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号 9 によって定義される HPPD をコードする配列番号 8 と同一の DNA 配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA 1 株)、分離株 r003041 、より好ましくは配列番号 11 によって定義される HPPD をコードする配列番号 10 と同一の DNA 配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA 1 株)、分離株 r002040 、より好ましくは配列番号 13 によって定義される HPPD をコードする配列番号 12 と同一の DNA 配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号 15 によって定義される HPPD をコードする配列番号 14 と同一の DNA 配列を含むもの、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号 17 によって定義される HPPD をコードする配列番号 16 と同一の DNA 配列を含むものからなる生物の群の 1 構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードする DNA 配列を含み、または(I I)前記で定義の生物の HPPD をコードする遺伝子の 1 以上の突然変異 DNA 配列、好ましくは WO 2010 / 085705 、 U S 6 , 245 , 968 、 WO 2009 / 144079 、 PCT / EP 2010 / 070561 、 PCT / EP 2010 / 070567 、 PCT / EP 2010 / 070578 、 PCT / EP 2010 / 070570 、または PCT / EP 2010 / 070575 に記載の突然変異体を含む 1 以上のキメラ遺伝子を含むことで上記で定義の N - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくは N - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩に対して耐性の植物を得る方法であって、その植物が、 5 位および適宜に 3 位に、宿主生物で機能することが可能なコード配列ならびに異種調節要素を含む(I)(a)カラスムギ属、好ましくはカラスムギ(*Avena sativa*)、より好ましくは配列番号 2 によって定義される HPPD をコードする配列番号 1 と同一の DNA 配列を含むもの、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号 4 によって定義される HPPD をコードする配列番号 3 と同一の DNA 配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ(*Synechococcoidae*)、好ましくはシネココッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号 7 によって定義される HPPD

20

30

40

50

をコードする配列番号 6 と同一の DNA 配列を含むもの、(d) アミカ (*Blepharis midae*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム (*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号 9 によって定義される HPPD をコードする配列番号 8 と同一の DNA 配列を含むもの、(e) ロドコッカス (*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス (*Rhodococcus*) 属種 (RHA 1 株)、分離株 r003041、より好ましくは配列番号 11 によって定義される HPPD をコードする配列番号 10 と同一の DNA 配列またはロドコッカス (*Rhodococcus*) 属種 (RHA 1 株)、分離株 r002040、より好ましくは配列番号 13 によって定義される HPPD をコードする配列番号 12 と同一の DNA 配列を含むもの、(f) ピクロフィルス科 (*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス (*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号 15 によって定義される HPPD をコードする配列番号 14 と同一の DNA 配列を含むもの、(g) コルディア (*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ (*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号 17 によって定義される HPPD をコードする配列番号 16 と同一の DNA 配列を含むものからなる生物の群の 1 構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ (HPPD) をコードする DNA 配列を含み、または (I) 前記で定義の生物の HPPD をコードする遺伝子の 1 以上の突然変異 DNA 配列、好ましくは WO 2010 / 085705、US 6,245,968、WO 2009 / 144079、PCT / EP 2010 / 070561、PCT / EP 2010 / 070567、PCT / EP 2010 / 070578、PCT / EP 2010 / 070570、または PCT / EP 2010 / 070575 に記載の突然変異体を含む 1 以上のキメラ遺伝子を含むことを特徴とし、前記コード配列が上述の本発明の HPPD をコードする遺伝子を定義する核酸配列を少なくとも含むことで、上記で定義の N - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくは N - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩に対する十分に高レベルの耐性を発揮することを特徴とする方法に関するものもある。
10
20

【0105】

本発明の 1 実施態様においては、上記方法における HPPD 阻害剤は、単独で、またはトリケトンまたはピラゾリネット除草剤、好ましくは、テンボトリオン、メソトリオン、ビシクロピロン、テフリルトリオン、ピラスルホトール、ピラゾレート、ジケトニトリル、ベンゾフェナップまたはスルコトリオン、特にはテンボトリオンからなる群から選択される 1 以上の HPPD 阻害薬型除草剤と組み合わせた上記で定義の N - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくは N - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩である。
30

【0106】

本発明は、植物を植えるもしくは種子を播種する農地または作物において、そのような農地もしくは作物に上記で定義の N - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくは N - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩を施用することで、雑草を選択的に除去するまたは雑草の発芽を防止する方法であって、この上記で定義の N - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくは N - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩を、作物を播種する前 (以下、播種前施用と称する)、作物の発芽前 (以下、発芽前施用と称する)、または作物の発芽後 (以下、出芽後施用と称する) のいずれかで、(I) (a) カラスムギ属、好ましくはカラスムギ (*Avena sativa*)、より好ましくは配列番号 2 によって定義される HPPD をコードする配列番号 1 と同一の DNA 配列を含むもの、(b) シュードモナス (*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌 (*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号 4 によって定義される HPPD をコードする配列番号 3 と同一の DNA 配列を含むもの、(c) シネココッコイデアエ (*Synechococcoidae*)、好ましくはシネココッカス (*Synechococcus*) 属種、より好ましくは配列番号 7 によって定義される HPPD をコードする配列番号 6 と同一の DNA 配列を含むも
40
50

の、(d)アミカ(*Blepharismaidæ*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードするDNA配列を含み、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含む1以上のキメラ遺伝子に従って形質転換された植物に施用することを特徴とする方法に関するものである。
10
20

【0107】

本発明は、また、本発明において前述の形質転換種子を含む区域または農地を管理する方法であって、農地の前記区域に、(I)(a)カラスマギ属、好ましくはカラスマギ(*Avenasativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ(*Synechococcoideae*)、好ましくはシネココッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(*Blepharismaidæ*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードするDNA配列を含み、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/07
30
40
50

0561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578
 、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含む1以上のキメラ遺伝子を含む種子または植物にほとんど影響を与えることなく、前記雑草に毒性である用量の上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩を施用することを含む方法に関するものもある。

【0108】

本発明は、また、(I)(a)カラスムギ属、好ましくはカラスムギ(*Avena sativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ(*Synechococcoideae*)、好ましくはシネココッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(*Blepharisma*)、好ましくはブレファリスマ・ジャボニクム(*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードするDNA配列を含み、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含む1以上のキメラ遺伝子で形質転換された植物を栽培する方法であって、前記のキメラ遺伝子を含む種子を前記植物の栽培に適した農地の区域に播種し、そして、雑草が存在する場合、前記農地の前記区域に、前記形質転換種子または前記形質転換植物にほとんど影響を与えることなく、雑草に毒性である用量の1以上の上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩を施用し、次に、所望の成熟期に達したときに栽培植物または植物部分を収穫し、適切な場合には、収穫した植物から種子を分離することを含む方法に関するものもある。

【0109】

上記方法において、上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩を、本発明に従つて、作物を播種する前、作物の出芽前または作物の出芽後のいずれかに施用することができる。

【0110】

本発明の意味の範囲内において、「除草剤」は、それ自身で除草活性な物質またはそれ

10

20

30

40

50

の効力を変える添加剤、例えば、その活性を高める薬剤（相乗作用剤）またはその活性を制限する薬剤（薬害軽減剤）と組み合わせたそのような物質であると理解される。当然のことながら、実際のそれらの施用においては、上記除草剤は、農芸化学で慣例的に用いられる製剤補助剤とそれ自体公知の方法で組み合わせるものと理解すべきである。

【0111】

従って、(I)(a)カラスムギ属、好ましくはカラスムギ(*Avena sativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネコッコイデアエ(*Synechococcoideae*)、好ましくはシネコッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(*Blepharisma*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(*RHA1*株)、分離株ro03041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(*RHA1*株)、分離株ro02040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードするDNA配列を含み、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含む1以上のキメラ遺伝子に加えて、相同(=天然)遺伝子または遺伝子配列の過剰発現、抑制もしくは阻害、または非相同(=外来)遺伝子または遺伝子配列の発現の結果として改変された特性を有するトランスジェニック植物を得ることができる。

【0112】

(I)(a)カラスムギ属、好ましくはカラスムギ(*Avena sativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネコッコイデアエ(*Synechococcoideae*)、好ましくはシネコッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(*Blepharisma*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(*RHA1*株)、分離株ro03041、より好ましくは配列番号11によって定義されるH

10

20

30

40

50

P P Dをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(*RHA*1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由來のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードするDNA配列を含み、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含む1以上のキメラ遺伝子を含む植物、植物細胞もしくは種子に関して、トリケトン類、例えば、テンボトリオン、スルコトリオンおよびメソトリオン、またはピラゾリネート類、例えば、ピラスルホトールおよびトプラメゾン、特には、テンボトリオン、スルコトリオン、トプラメゾン、ビシクロピロン、テフリルトリオンおよびメソトリオンから選択される、詳細にはテンボトリオンに属する1以上の別のHPPD阻害薬型除草剤と組み合わせた1以上の上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩を、例えば、2,4-Dもしくはジカンバなどの成長調節剤に対して、または必須の植物酵素、例えばアセト乳酸シンターゼ(ALS)、EPS SPシンターゼ、グルタミンシンターゼ(GS)、アセチル-コエンザイムAカルボキシラーゼ(ACCase)を阻害する除草剤に対して、またはスルホニル尿素類、イミダゾリノン類、グリホセートも、グリホシネット、ACCase阻害薬および類似の活性物質の群からの除草剤に対しても耐性であるトランスジェニック作物において用いることが好ましい。
【0113】

従って本発明は、1以上の上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩に対する抵抗性以外に、第2以上の除草剤抵抗性を含むトランスジェニック作物にも拡大される、有害植物(すなわち雑草)防除のための、(I)(a)カラスムギ属、好ましくはカラスムギ(*Avenasativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ(*Synechococcoidae*)、好ましくはシネココッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(*Blepharismaidae*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(*RHA*1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(*RHA*1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torri*

d u s)、より好ましくは配列番号 15 によって定義される H P P D をコードする配列番号 14 と同一の DNA 配列を含むもの、(g) コルディア (K o r d i a) 、好ましくはコルディア・アルギシダ (K o r d i a a l g i c i d a) 、より好ましくは配列番号 17 によって定義される H P P D をコードする配列番号 16 と同一の DNA 配列を含むものからなる生物の群の 1 構成員由来の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) をコードする DNA 配列を含み、または (I I) 前記で定義の生物の H P P D をコードする遺伝子の 1 以上の突然変異 DNA 配列、好ましくは W O 2 0 1 0 / 0 8 5 7 0 5 、 U S 6 , 2 4 5 , 9 6 8 、 W O 2 0 0 9 / 1 4 4 0 7 9 、 P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 6 1 、 P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 6 7 、 P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 8 、 P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 0 、または P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 5 に記載の突然変異体を含む 1 以上のキメラ遺伝子を含む H P P D 耐性植物に施用される除草剤の使用に関するものである。
10

【 0 1 1 4 】

上記で定義の N - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくは N - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩は、必要とされる一般的な生理的および / または物理化学的パラメータに応じて、各種形態で製剤することができる。可能な製剤の例としては、水和剤 (W P) 、水溶剤 (S P) 、水溶性濃縮物、乳剤 (E C) 、乳濁液 (E W) 、例えば水中油および油中水型乳濁液、噴霧液、懸濁液の濃縮物 (S C) 、油もしくは水に基づく分散液、油剤、カプセル懸濁液 (C S) 、粉剤 (D P) 、種子粉衣製品、散布によるおよび土壤への施用用の粒剤、微粒剤の形態の粒剤 (G R) 、噴霧粒剤、被覆粒剤および吸着粒剤、水分散性粒剤 (W G) 、水溶性粒剤 (S G) 、 U L V 製剤、マイクロカプセルならびにロウなどがある。
20

【 0 1 1 5 】

これらの個々の製剤タイプは基本的に公知であり、例えば、 Winnacker - Kuechler , Chemische technologie [Chemical Technology] , 第 7 卷 , C . Hanser Verlag Munich , 第 4 版 1986 , Wade van Valkenburg , Pesticide Formulations , Marcel Dekker , N . Y . , 1973 ; K . Martens , Spray Drying Handbook , 第 3 版 1979 , G . Goodwin Ltd . London に記載されている。
30

【 0 1 1 6 】

また、不活性材料、界面活性剤、溶媒およびさらなる添加剤のような必要な製剤補助剤も知られており、例えば Watkins , Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers , 第 2 版 , Darland Books , Caldwell N . J . ; H . v . Olphen , Introduction to Clay Colloid Chemistry ; 第 2 版 , J . Wiley & Sons , N . Y . ; C . Marsden , Solvents Guide ; 第 2 版 , Interscience , N . Y . 1963 ; McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual , MC Publ . Corp . , Ridgewood N . J . ; Sisley and Wood , Encyclopedia of Surface Active Agents , Chem . Publ . Co . Inc . , N . Y . 1964 ; Schoenfeldt , Grenzflaechenaktive Aethylenoxidaddukte [Interface-active ethylene oxide adducts] , Wiss . Verlagsgesell . , Stuttgart 1976 ; Winnacker - Kuechler , Chemische Technologie [Chemical technology] , 第 7 卷 , C . Hanser Verlag Munich , 第 4 版 1986 . に記載されている。
40
50

【0117】

これらの製剤に基づいて、例えば調合済み剤またはタンクミックスの形態で、例えば殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、殺菌剤などの他の農薬活性物質との、そして薬害軽減剤、肥料および／または成長調節剤との組み合わせ剤を製造することも可能である。

【0118】

水和剤は、水中に均一に分散可能であり、そして活性物質に加えて、希釈剤または不活性物質は別として、イオン系および／またはノニオン系界面活性剤（湿潤剤、分散剤）、例えばポリオキシエチル化アルキルフェノール、ポリオキシエチル化脂肪族アルコール、ポリオキシエチル化脂肪族アミン、脂肪族アルコールポリグリコールエーテルサルフェート、アルカンスルホン酸エステル、アルキルベンゼンスルホン酸エステル、リグノスルホン酸ナトリウム、2,2'-ジナフチルメタン-6,6'-ジスルホン酸ナトリウム、ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウムまたは他にオレオイルメチルタウリン酸ナトリウムを含む製剤である。水和剤を調製するには、除草活性物質を、例えばハンマーミル、ブロワミルおよびエアジェットミルのような慣用の装置中で微粉碎し、そして同時にまたはその後で製剤補助剤と混合する。10

【0119】

乳剤は、活性物質を有機溶媒、例えばブタノール、シクロヘキサン、ジメチルホルムアミド、キシレンまたは他に相対的に高沸点の芳香族もしくは炭化水素または有機溶媒の混合物中に溶解し、1以上のイオン系および／またはノニオン系界面活性剤（乳化剤）を添加することによって製造される。使用可能な乳化剤の例は、アルキルアリールスルホン酸カルシウム塩、例えばデシルベンゼンスルホン酸カルシウム、またはノニオン系乳化剤、例えば脂肪酸ポリグリコールエステル、アルキルアリールポリグリコールエーテル、脂肪族アルコールポリグリコールエーテル、プロピレンオキサイド-エチレンオキシド縮合物、アルキルポリエーテル、ソルビタンエステル、例えばソルビタン脂肪酸エステルまたはポリオキシエチレンソルビタンエステル、例えばポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステルである。20

【0120】

粉剤は、微粉碎された固体材料、例えばタルク、自然粘土、例えばカオリン、ベントナイトおよびピロフィライトまたは珪藻土と共に有効成分を粉碎することによって得られる。30

【0121】

懸濁濃縮物は、水または油に基づくものであることができる。それは、例えば、市販のビーズミルによる湿式粉碎によって、適切な場合は、例えば他の製剤タイプの場合にすでに上記で挙げた界面活性剤を添加して製造することができる。

【0122】

乳濁液、例えば水中油型乳濁液（EW）は、例えば水系有機溶媒および適切であれば、例えば他の製剤タイプについて前記すでに挙げた界面活性剤を用いて攪拌機、コロイドミルおよび／またはスタティックミキサーによって製造することができる。

【0123】

粒剤は、吸着性の顆粒状不活性材料上に活性物質を噴霧することによって、または粘着剤、例えばポリビニルアルコール、ポリアクリル酸ナトリウムもしくは他に鉛油を用いて、担体物質、例えば砂土、カオリナイトもしくは顆粒状不活性材料の表面に活性物質濃縮液を塗布することによって製造することができる。また、好適な活性物質を、所望の場合に肥料との混合物として、肥料顆粒の製造に慣用のやり方で造粒することもできる。40

【0124】

顆粒水和剤は、一般に噴霧乾燥、流動床造粒、ディスク造粒、高速攪拌機による混合、および固形不活性材料なしの押出といったような慣用の方法によって製造される。

【0125】

ディスク粒剤、流動床粒剤、押出粒剤および噴霧粒剤を製造するためには、例えば S pray - D r y i n g H a n d b o o k 第3版 1979, G. Goodwi50

n Ltd., London; J. E. Browning, Agglomeration, Chemical and Engineering 1967, 第147頁以下; Perry's Chemical Engineers Handbook, 第5版, McGraw-Hill, New York 1973, 第8-57頁における方法を参照する。

【0126】

作物保護製品の製剤のさらなる詳細については、例えば、G. C. Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, 第81-96頁およびJ. D. Freyer, S. A. Evans, Weed Control Handbook, 第5版, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, 第101-103頁を参照する。
10

【0127】

基本的に、農薬製剤は、0.1から99重量%、特には0.1から95重量%の本発明による化合物を含む。水和剤では、活性物質の濃度は、例えば約10から90重量%であり；100重量%までの残りは、慣用の製剤成分からなる。乳剤の場合、活性物質の濃度は、約1から90重量%、好ましくは5から80重量%であることができる。粉剤タイプの製剤は、1から30重量%の活性物質、好ましくはほとんどの場合で5から20重量%の活性物質の量を含むことができ；噴霧液は、約0.05から80重量%、好ましくは2から50重量%の活性物質を含む。顆粒水和剤の場合、活性物質含量は、活性化合物が固体であるか液体であるか、そして造粒助剤、充填剤などが使用されるかによって部分的に決まる。水中に分散可能な顆粒剤の場合、例えば、活性物質の含量は、1から95重量%、好ましくは10から80重量%である。
20

【0128】

さらに、記載された活性物質製剤は、粘着付与剤、湿展剤、分散剤、乳化剤、浸透剤、保存剤、不凍剤および溶媒、充填剤、担体、着色剤、消泡剤、蒸発抑制剤ならびにpHおよび粘度調節剤などの各場合で従来からの補助剤を含んでいる。

【0129】

これらの製剤に基づいて、例えば、本発明によるHPPD耐性植物に施用される成分調合済み剤のまたはタンクミックスの形態で、例えば殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、殺菌剤などの他の農薬活性物質と、そして葉害軽減剤、肥料および/または成長調節剤と、トリケトン類、例えば、テンボトリオン、スルコトリオンおよびメソトリオン、またはピラゾリネット類、例えば、ピラスルホトールおよびトプラメゾン、特には、テンボトリオン、スルコトリオン、トプラメゾン、ビシクロビロン、テフリルトリオンおよびメソトリオンから選択される、より詳細にはテンボトリオンであるHPPD阻害薬型除草剤との組み合わせ剤を製造することも可能である。
30

【0130】

製剤例

a) 粉剤は式(I)の化合物および/またはその塩10重量部と不活性物質としてのタルク90重量部を混合し、その混合物をハンマーミルで粉碎することにより得られる。
40

【0131】

b) 容易に水に分散しうる水和剤は式(I)の化合物および/またはその塩25重量部、不活性物質としてのカオリン含有石英64重量部、リグノスルホン酸カリウム10重量部ならびに湿展剤および分散剤としてのオレオイルメチルタウリン酸ナトリウム1重量部のを混合し、その混合物をピン付きディスクミルで粉碎することにより得られる。

【0132】

c) 容易に水に分散しうる分散液濃縮物は式(I)の化合物および/またはその塩20重量部をアルキルフェノールポリグリコールエーテル(Triton(登録商標)X207)6重量部、イソトリデカノールポリグリコールエーテル(8EO)3重量部およびパラフィン系鉱油(沸点範囲:例えば約255から277)71重量部と混合し、その
50

混合物をボールミルで5ミクロン以下の粉末度まで粉碎することにより得られる。

【0133】

d) 乳剤は式(I)の化合物および/またはその塩15重量部、溶媒としてのシクロヘキサン75重量部および乳化剤としてのオキシエチル化ノニルフェノール10重量部から得られる。

【0134】

e) 顆粒水和剤は、

式(I)の化合物および/またはその塩75重量部、

リグノスルホン酸カルシウム10重量部、

ラウリル硫酸ナトリウム5重量部、

ポリビニルアルコール3重量部および

カオリン7重量部

10

を混合し、その混合物をピン付きディスクミルで粉碎し、その粉末を造粒液としての水に噴霧して流動床で造粒することにより得られる。

【0135】

f) 顆粒水和剤はまた、

式(I)の化合物および/またはその塩25重量部、

ナトリウム2,2'-ジナフチルメタン-6,6'-ジスルホン酸ナトリウム5重量部

,

オレオイルメチルタウリン酸ナトリウム2重量部、

20

ポリビニルアルコール1重量部、

炭酸カルシウム17重量部および

水50重量部

をコロイドミルで均質化および予備粉碎し、次にその混合物をビーズミルで粉碎し、得られた懸濁液を噴霧塔で単一物質ノズルにより噴霧および乾燥することにより得られる。

【0136】

本発明のさらに別の態様は、混合製剤またはタンクミックスの形態でトリケトン類、例えば、テンボトリオン、スルコトリオンおよびメソトリオンに属する、またはピラゾリネート類、例えば、ピラスルホトールおよびトプラメゾンに属する、特にはテンボトリオン、スルコトリオン、トプラメゾン、ビシクロピロン、テフリルトリオンおよびメソトリオンから選択される、より具体的には、テンボトリオンである別のHPPD阻害型除草剤と組み合わせての、および/または例えばWeed Research 26 (1986) 441-445またはThe Pesticide Manual, 14th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2003およびそこで引用されている文献に記載の、例えばアセト乳酸シンターゼ、アセチル-CoAカルボキシラーゼ、セルロースシンターゼ、エノールピルビルシキミ酸-3-リン酸シンターゼ、グルタミンシンテターゼ、p-ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ、フィトエンデサチュラーゼ、光化学系I、光化学系II、プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼの阻害に基づく別の公知の活性物質と組み合わせての、(I)(a)カラスムギ属、好ましくはカラスムギ(Avena sativa)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(Pseudomonas)、好ましくは蛍光菌(Pseudomonas fluorescens)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ(Synechococcus coideae)、好ましくはシネココッカス(Synechococcus)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(Blepharis midiae)、好ましくはブレファリスマ・ジャボニクム(Blepharisma japonicum)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする

30

40

50

ドする配列番号 8 と同一の DNA 配列を含むもの、(e) ロドコッカス (*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス (*Rhodococcus*) 属種 (RHA1 株)、分離株 r003041、より好ましくは配列番号 11 によって定義される HPPD をコードする配列番号 10 と同一の DNA 配列またはロドコッカス (*Rhodococcus*) 属種 (RHA1 株)、分離株 r002040、より好ましくは配列番号 13 によって定義される HPPD をコードする配列番号 12 と同一の DNA 配列を含むもの、(f) ピクロフィルス科 (*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス (*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号 15 によって定義される HPPD をコードする配列番号 14 と同一の DNA 配列を含むもの、(g) コルディア (*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ (*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号 17 によって定義される HPPD をコードする配列番号 16 と同一の DNA 配列を含むものからなる生物の群の 1 構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ (HPPD) をコードする DNA 配列を含み、または (II) 前記で定義の生物の HPPD をコードする遺伝子の 1 以上の突然変異 DNA 配列、好ましくは WO 2010/085705、US 6,245,968、WO 2009/144079、PCT/EP 2010/070561、PCT/EP 2010/070567、PCT/EP 2010/070578、PCT/EP 2010/070570、または PCT/EP 2010/070575 に記載の突然変異体を含む 1 以上のキメラ遺伝子を含む HPPD 耐性植物に対する 1 以上の上記で定義の N - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくは N - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩の使用である。本発明による化合物と組み合わせることができる公知の除草剤または植物成長調節剤は、例えば、下記活性物質 (その化合物は、国際標準化機構 (ISO) に従って一般名称または化学名で、適切な場合にはそのコード番号と共に標記される) であり、常に、酸、塩、エステルおよび異性体、例えば立体異性体および光学異性体などの全ての使用形態を含む。この文脈において、一つおよび場合により、いくつかの使用形態を例を挙げて記載する。

【0137】

アセトクロル、アシベンゾラル、アシベンゾラル - S - メチル、アシフルオルフェン、アシフルオルフェン - ナトリウム、アクロニフェン、アラクロール、アリドクロール、アロキシジム、アロキシジム - ナトリウム、アメトリン、アミカルバゾン、アミドクロル、アミドスルフロン、アミノシクロピラクロル、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、アンシミドール、アニロホス、アスマム、アトラジン、アザフェニジン、アジムスルフロン、アジプロトリン、BAH - 043、BAS - 140H、BAS - 693H、BAS - 714H、BAS - 762H、BAS - 776H、BAS - 800H、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、ベンスリド、ベンスルフロン - メチル、ベンタゾン、ベンズフェンジゾン、ベンゾビシクロロン、ベンゾフェナップ、ベンゾフルオル、ベンゾイルプロップ、ビフェノックス、ビラナホス、ビラナホス - ナトリウム、ビスピリバック、ビスピリバック - ナトリウム、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、プロムロン、ブミナホス、ブソキシノン (*busoxazine*)、ブタクロール、ブタフェナシル、ブタミホス、ブテナクロール、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、カルフェントラゾン - エチル、クロメトキシフェン、クロランベン、クロラジホップ、クロラジホップ - ブチル、クロルブロムロン、クロルブファム、クロルフェナク、クロルフェナク - ナトリウム、クロルフェンプロップ、クロルフルレノール、クロルフルレノール - メチル、クロリダゾン、クロリムロン、クロリムロン - エチル、クロルメコート - クロリド、クロルニトルフェン、クロロフタリム (*chlorophthalim*)、クロルタール - ジメチル、クロロトルロン、クロルスルフロン、シニドン、シニドン - エチル、シンメチリン、シノスルフロン、クレトジム、クロジナホップ、クロジナホップ - プロパルギル、クロフェンセット、クロマゾン、クロメプロップ、クロプロップ、クロピラリド、クロランスマム、クロランス

ラム - メチル、クミルロン、シアナミド、シアナジン、シクラニリド、シクロエート、シクロスルファムロン、シクロキシジム、シクルロン、シハロホップ、シハロホップ - ブチル、シペルコート、シプラジン、シプラゾール、2 , 4 - D、2 , 4 - DB、ダイムロン (d aimuron) / ダイムロン (d y m r o n) 、ダラポン、ダミノジド、ダゾメット、n - デカノール、デスマジファム、デスマトリン、デトシル - ピラゾレート (D T P) 、ダイアレート (d i a l l a t e) 、ジカンバ、ジクロベニル、ジクロルプロップ、ジクロルプロップ - P、ジクロホップ、ジクロホップ - メチル、ジクロホップ - P - メチル、ジクロスラム、ジエタチル、ジエタチル - エチル、ジフェノクスロン、ジフェンゾコート、ジフルフェニカン、ジフルフェンゾビル、ジフルフェンゾビル - ナトリウム、ジメフロン、ジケグラック - ナトリウム、ジメフロン、ジメピペレート、ジメタクロール、ジメタメトリン、ジメテナミド、ジメテナミド - P、ジメチピン、ジメトラスルフロン、ジニトラミン、ジノセブ、ジノテルブ、ジフェナミド、ジプロペトリン、ジクワット、ジクワット - ジブロミド、ジチオピル、ジウロン、D N O C、エグリナジン - エチル、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、エテホン、エチジムロン、エチオジン、エトメセート、エトキシフェン、エトキシフェン - エチル、エトキシスルフロン、エトベンザニド、F - 5 3 3 1、すなわちN - [2 - クロロ - 4 - フルオロ - 5 - [4 - (3 - フルオロプロピル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 5 - オキソ - 1 H - テトラゾール - 1 - イル] フェニル] エタンスルホンアミド、フェノプロップ、フェノキサプロップ、フェノキサプロップ - P、フェノキサプロップ - エチル、フェノキサプロップ - P - エチル、フェントラザミド、フェヌロン、フラムプロップ、フラムプロップ - M - イソプロピル、フラムプロップ - M - メチル、フラザスルフロン、フロラスラム、フルアジホップ、フルアジホップ - P、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 (f lu a z o l a t e) 、フルカルバゾン、フルカルバゾン - ナトリウム、フルセトスルフロン、フルクロラリン、フルフェナセット (チフルアミド (t h i a f l u a m i d e)) 、フルフェンピル、フルフェンピル - エチル、フルメトラリン、フルメツラム、フルミクロラック、フルミクロラック - ペンチル、フルミオキサジン、フルミプロピン、フルオメツロン、フルオロジフェン、フルオログリコフェン、フルオログリコフェン - エチル、フルポキサム、フルプロパシル、フルプロパネート、フルピルスルフロン、フルピルスルフロン - メチル - ナトリウム、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、フルロキシピル - メチル、フルルブリミドール、フルルタモン (f l u r t a m o n e) 、フルチアセット、フルチアセット - メチル、フルチアミド (f l u t h i a m i d e) 、ホメサフェン、ホラムスルフロン、ホルクロルフェニュロン、ホサミン、フリルオキシフェン (f u r y l o x y f e n) 、ジベレリン酸、グルホシネット、L - グルホシネット、L - グルホシネット - アンモニウム、グルホシネット - アンモニウム、グリホセート、グリホセート - イソプロピルアンモニウム、H - 9 2 0 1、ハロサafen (h a l o s a f e n) 、ハロスルフロン、ハロスルフロン - メチル、ハロキシホップ、ハロキシホップ - P、ハロキシホップ - エトキシエチル、ハロキシホップ - P - エトキシエチル、ハロキシホップ - メチル、ハロキシホップ - P - メチル、ヘキサジノン、H N P C - 9 9 0 8、H O K - 2 0 1、H W - 0 2、イマザメタベンズ、イマザメタベンズ - メチル、イマザモックス、イマザピック、イマザピル、イマザキン、イマゼタピル、イマゾスルフロン、イナベンフィド、インダノファン、インドール酢酸 (I A A) 、4 - インドール - 3 - イル酛酸 (I B A) 、ヨードスルフロン、ヨードスルフロン - メチル - ナトリウム、イオキシニル、イソカルバミド、イソプロパリン、イソプロツロン、イソウロン、イソキサベン、イソキサクロトール、イソキサフルトール、イソキサピリホップ、K U H - 0 4 3、K U H - 0 7 1、カルブチレート、ケトスピラドックス (k e t o s p i r a d o x) 、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、M C P B、M C P B - メチル、- エチルおよび - ナトリウム、メコプロップ、メコプロップ - ナトリウム、メコプロップ - ブチル、メコプロップ - P - ブチル、メコプロップ - P - ジメチルアンモニウム、メコプロップ - P - 2 - エチルヘキシル、メコプロップ - P - カリウム、メフェナセット 10
20
30
40
50

、メフルイジド、メピコート - クロリド、メソスルフロン、メソスルフロン - メチル、メタベンズチアズロン、メタム、メタミホップ (met ami f o p) 、メタミトロン、メタザクロール、メタゾール、メトキシフェノン、メチルダイムロン、1 - メチルシクロブロベン、イソチオシアノ酸メチル、メトベンズロン、メトプロムロン、メトラクロール、S - メトラクロール、メトラム、メトクスロン、メトリブジン、メツルフロン、メツルフロン - メチル、モリネート、モナリド、モノカルバミド、モノカルバミドニ水素硫酸塩、モノリニュロン、モノスルフロン、モニュロン、MT - 128、MT - 5950、すなわちN - [3 - クロロ - 4 - (1 - メチルエチル) - フェニル] - 2 - メチルペンタンアミド、NGGC - 011、ナプロアニリド、ナプロパミド、ナプタラム、NC - 310、すなわち4 - (2 , 4 - ジクロロベンゾイル) - 1 - メチル - 5 - ベンジルオキシピラゾール、ネブロン、ニコスルフロン、ニピラクロフェン、ニトラリン、ニトロフェン、ニトロフェノラト - ナトリウム (nitrophenolat sodium) (異性体混合物)、ニトロフルオルフェン、ノナン酸、ノルフルラゾン、オルベンカルブ、オルソスルファムロン、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、オキサジクロメフォン、オキシフルオルフェン、パクロブトラゾール、パラコート、パラコートジクロリド、ペラルゴン酸 (ノナン酸) 、ベンジメタリン、ペンドラリン (pendralin) 、ペノキスラム、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、フェニソファム、フェンメジファム、フェンメジファム - エチル、ピクロラム、ピコリナフェン、ピノキサデン、ピペロホス、ピリフェノップ、ピリフェノップ - ブチル、プレチラクロール、プリミスルフロン、プリミスルフロン - メチル、プロベナゾール、プロフルアゾール (profluazol) 、プロシアジン、プロジアミン、プリフルラリン (prifluraline) 、プロホキシジム (prof oxydim) 、プロヘキサジオン、プロヘキサジオン - カルシウム、プロヒドロジヤスモン (prohydr ojasmon) 、プロメトン、プロメトリン、プロパクロル、プロパニル、プロパキザホップ、プロパジン、プロファム、プロビソクロール、プロポキシカルバゾン、プロポキシカルバゾン - ナトリウム、プロピザミド、プロスルファリン、プロスルホカルブ、プロスルフロン、プリナクロール、ピラクロニル、ピラフルフェン、ピラフルフェン - エチル、ピラゾリネット (ピラゾレート) 、ピラゾスルフロン - エチル、ピラゾキシフェン、ピリバムベンズ (pyribambenz) 、ピリバムベンズ - イソプロピル、ピリベンゾキシム、ピリブチカルブ、ピリダフォル (pyridafol) 、ピリデート、ピリフタリド、ピリミノバック (pyriminobac) 、ピリミノバック - メチル、ピリミスルファン、ピリチオバック、ピリチオバック - ナトリウム、ピロキサスルホン (pyroxasulfone) 、ピロキシスラム (pyroxosulam) 、キンクロラック、キンメラック、キノクラミン、キザロホップ、キザロホップ - エチル、キザロホップ - P 、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、セクブメトン、セトキシジム、シデュロン、シマジン、シメトリン、SN - 106279、スルファレート (DEC) 、スルフェントラゾン、スルホメツロン、スルホメツロン - メチル、スルホセート (グリホセート - トリメシウム) 、スルホスルフロン、SYN - 523、SYP - 249、SYP - 298、SYP - 300、テブタム、テブチウロン、テクナゼン、テプラロキシジム、テルバシル、テルブカルブ、テルブクロル、テルブメトン、テルブチラジン、テルブトリン (terbutryne) 、TH - 547 、テニルクロール、チアフルアミド (thiafluamide) 、チアザフルロン、チアゾピル、チジアジミン、チジアズロン (thidiiazuron) 、チエンカルバゾン、チエンカルバゾン - メチル、チフェンスルフロン、チフェンスルフロン - メチル、チオベンカルブ、チオカルバジル、トラルコキシジム、トリアラート、トリアスルフロン、トリアジフラム (triaziflam) 、トリアゾフェナミド、トリベヌロン、トリベヌロン - メチル、トリクロロ酢酸 (TCA) 、トリクロピル、トリジファン、トリエタジン、トリフロキシスルフロン、トリフロキシスルフロン - ナトリウム、トリフルラリン、トリフルスルフロン、トリフルスルフロン - メチル、トリメツロン、トリネキサパック、トリネキサパック - エチル、トリトスルフロン (tritosulfuron) 、チトデフ

10

20

30

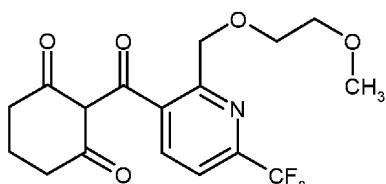
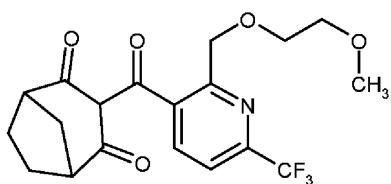
40

50

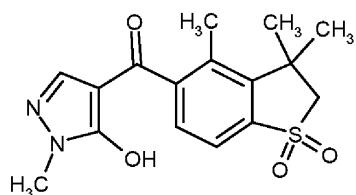
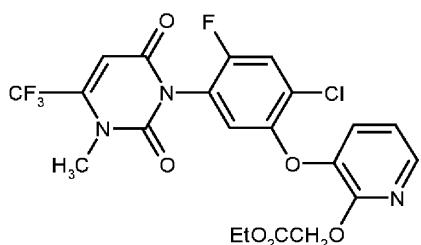
、ユニコナゾール、ユニコナゾール-P、ペルノレート、ZJ-0166、ZJ-0270、ZJ-0543、ZJ-0862および以下の化合物。

【0138】

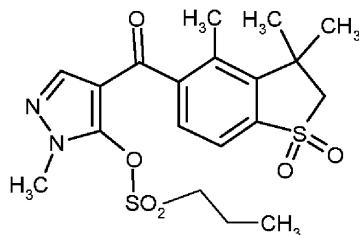
【化10】



10



20



(I) (a) カラスムギ属、好ましくはカラスムギ (*Avena sativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b) シュードモナス (*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌 (*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c) シネコッコイデアエ (*Synechococcoideae*)、好ましくはシネコッカス (*Synechococcus*) 属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d) アミカ (*Blepharismaidae*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム (*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e) ロドコッカス (*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス (*Rhodococcus*) 属種 (*RHA1* 株)、分離株 *r003041*、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス (*Rhodococcus*) 属種 (*RHA1* 株)、分離株 *r002040*、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f) ピクロフィルス科 (*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス (*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g) コルディア (*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ (*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由來のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ (HPPD) をコードするDNA配列を

30

40

50

含み、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含む1以上のキメラ遺伝子を含むHPPD耐性植物が成長している区域に施用される上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩の必要な施用量は、温度、湿度、使用される除草剤の性質などの外部条件に応じて変動する。それは広い範囲内で変動し得るものであり、例えば0.001から1.0kg/ha以上の活性物質であるが、好ましくはそれは0.005から750g/haである。
10

【0139】

(I)(a)カラスムギ属、好ましくはカラスムギ(*Avenasativa*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(*Pseudomonas*)、好ましくは蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ(*Synechococcoideae*)、好ましくはシネココッカス(*Synechococcus*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(*Blepharismaidæ*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(*Rhodococcus*)、好ましくはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(*RHA1株*)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(*RHA1株*)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(*Picrophilaceae*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(*Kordia*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由來のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)をコードするDNA配列を含み、または(II)前記で定義の生物のHPPDをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO2010/085705、US6,245,968、WO2009/144079、PCT/EP2010/070561、PCT/EP2010/070567、PCT/EP2010/070578、PCT/EP2010/070570、またはPCT/EP2010/070575に記載の突然変異体を含む1以上のキメラ遺伝子を含むHPPD耐性植物に対して、上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩とは異なる上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩除草剤の組み合わせ施用を行う場合、これらの混合物は、上記で定義のN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩とは異なる除草剤の存在によって作物に被害をもたらす可能性がある。そのような作物被害を低減/排除するために、適切な薬害軽減剤を加えてよい。これらの薬害軽減剤は解毒的に活性な量で用いられ、例えば穀類(コムギ、オオムギ、ライムギ、トウモロコシ、イネ、キビ)、アルファルファ、サトウダイコン、サトウキビ、アブラナ、ワタおよびダイ
20
30
40
50

ズ類、好ましくは、トウモロコシ、ワタ、サトウダイコンまたはダイズ類などの経済的に重要な作物において、使用される除草剤／農薬の植物毒性副作用を低減する。

【0140】

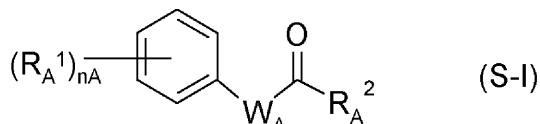
薬害軽減剤は好ましくは、下記のものからなる群から選択される。

【0141】

A) 式(S-1)の化合物：

【0142】

【化11】



10

[記号および指数は下記の意味を有し、

n_A は 0 から 5、好ましくは 0 から 3 の自然数であり；

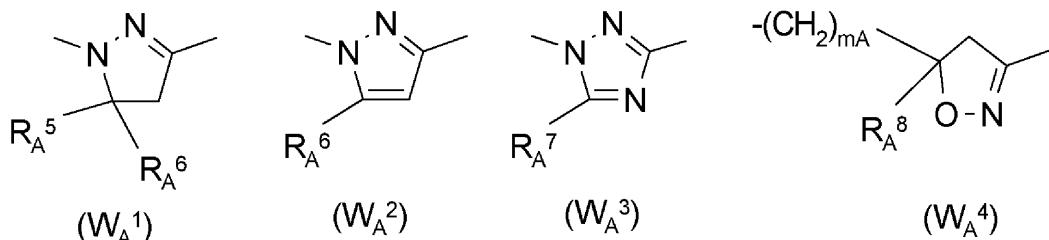
R_A^1 は、ハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、ニトロまたは(C₁ - C₄) - ハロアルキルであり；

W_A は、N および O 型の 1 から 3 個のヘテロ環原子を有する部分不飽和もしくは芳香族の 5 員複素環からなる群からの置換されていないか置換されている 2 値複素環基であり、その環には少なくとも 1 個の窒素原子および最大で 1 個の酸素原子が存在し、好ましくは下記の (W_A¹) から (W_A⁴) :

20

【0143】

【化12】



30

からなる群からの基であり；

m_A は 0 または 1 であり；

R_A^2 は、OR_A³、SR_A³ もしくはNR_A³R_A⁴ または少なくとも 1 個の窒素原子および 3 個以下のヘテロ原子（好ましくは O および S からなる群からの）を有する飽和もしくは不飽和の 3 から 7 員複素環（それは窒素原子を介して (S-1) におけるカルボニル基に結合しており、置換されていないか (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシおよび置換されていても良いフェニルからなる群からの基によって置換されている。）、好ましくは式 OR_A³、NHR_A⁴ または N(CH₃)₂ の基、特には式 OR_A³ の基であり；

40

R_A^3 は、水素または好ましくは合計で 1 から 18 個の炭素原子を有する置換されていないか置換されている脂肪族炭化水素基であり；

R_A^4 は、水素、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシまたは置換されているまたは置換されていないフェニルであり；

R_A^5 は、H、(C₁ - C₈) - アルキル、(C₁ - C₈) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ - (C₁ - C₈) - アルキル、シアノまたは COOR_A⁹ であり、R_A⁹ は水素、(C₁ - C₈) - アルキル、(C₁ - C₈) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₆) - ヒドロキシアルキル、(C₃ - C₁₂) - シクロアルキルまたはトリ - (C₁ - C₄) - アルキルシリルであり；

R_A^6 、 R_A^7 、 R_A^8 は同一であるか異なっており、水素、(C₁ - C₈) - アルキ

50

ル、(C₁ - C₈) - ハロアルキル、(C₃ - C₁₂) - シクロアルキルまたは置換されているか置換されていないフェニルである。】；

好ましくは：

a) ジクロロフェニルピラゾリン-3-カルボン酸型の化合物、好ましくは1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(エトキシカルボニル)-5-メチル-2-ピラゾリン-3-カルボン酸エチル(S1-1)（「メフェンピル-ジエチル」、Pestic. Man. 参照）などの化合物、およびWO91/07874に記載の関連化合物；

b) ジクロロフェニルピラゾールカルボン酸の誘導体、好ましくは1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-メチルピラゾール-3-カルボン酸エチル(S1-2)、1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-イソプロピルピラゾール-3-カルボン酸エチル(S1-3)、1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(1,1-ジメチルエチル)ピラゾール-3-カルボン酸エチル(S1-4)、1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-フェニルピラゾール-3-カルボン酸エチル(S1-5)などの化合物およびEP-A-333131およびEP-A-269806に記載の関連化合物；

c) トリアゾールカルボン酸型の化合物、好ましくはフェンクロラゾール(エチルエステル)、すなわち1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-トリクロロメチル-(1H)-1,2,4-トリアゾール-3-カルボン酸エチル(S1-6)などの化合物、およびEP-A-174562およびEP-A-346620に記載の関連化合物；

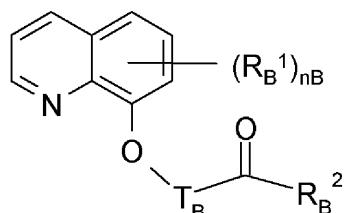
d) 5-ベンジル-もしくは5-フェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸型または5,5-ジフェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸型の化合物、好ましくは5-(2,4-ジクロロベンジル)-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸エチル(S1-7)または5-フェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸エチル(S1-8)などの化合物およびWO91/08202に記載の関連化合物、または特許出願WO95/07897に記載の5,5-ジフェニル-2-イソオキサゾリンカルボン酸エチル(S1-9)（「イソキサジフェン-エチル」）もしくは5,5-ジフェニル-2-イソオキサゾリンカルボン酸n-プロピル(S1-10)もしくは5-(4-フルオロフェニル)-5-フェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸エチル(S1-11)。

【0144】

B) 下記式(S-II)のキノリン誘導体：

【0145】

【化13】



(S-II)

[式中、記号および指数は下記の意味を有し、

R_B¹は、ハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、ニトロまたは(C₁ - C₄) - ハロアルキルであり；

n_Bは、0から5、好ましくは0から3の自然数であり；

R_B²は、OR_B³、SR_B³もしくはNR_B³R_B⁴または好ましくはOおよびSからなる群からの少なくとも1個の窒素原子および3個以下のヘテロ原子を有する飽和もしくは不飽和の3から7員複素環(それは窒素原子を介して(S-II)におけるカルボニル基に結合しており、置換されていないか(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルコキシもしくは置換されていても良いフェニルからなる群からの基によって置換されている。)、好ましくは式OR_B³、NHR_B⁴またはN(CH₃)₂の基、特にOR_B³の基であり；

10

20

30

40

50

R_B^3 は、水素または好ましくは合計で 1 から 18 個の炭素原子を有する置換されていないか置換されている脂肪族炭化水素基であり；

R_B^4 は、水素、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₁ - C₆) - アルコキシまたは置換されているまたは置換されていないフェニルであり；

T_B は、置換されていないか 1 個もしくは 2 個の(C₁ - C₄) - アルキル基または[(C₁ - C₃) - アルコキシ]カルボニルによって置換されている(C₁ または C₂) - アルカンジイル鎖である。】；

好ましくは、

a) 8 - キノリンオキシ酢酸型の化合物(S 2)、好ましくは(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)酢酸 1 - メチルヘキシル(一般名「クロキントセット - メキシル」、S 2 - 1)(Pestic. Man. 参照)、

(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)酢酸 1 , 3 - ジメチルブト - 1 - イル(S 2 - 2)、

(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)酢酸 4 - アリルオキシブチル(S 2 - 3)、

(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)酢酸 1 - アリルオキシプロプ - 2 - イル(S 2 - 4)、

(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)酢酸エチル(S 2 - 5)、

(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)酢酸メチル(S 2 - 6)、

(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)酢酸アリル(S 2 - 7)、

(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)酢酸 2 - (2 - プロピリデンイミノキシ) - 1 - エチル(S 2 - 8)、(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)酢酸 2 - オキソプロプ - 1 - イル(S 2 - 9)およびEP - A - 86750、EP - A - 94349およびEP - A - 191736またはEP - A - 0492366に記載の関連化合物、さらにはWO - A - 2002 / 034048に記載のそれらの水和物および塩；

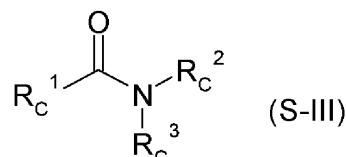
b) (5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)マロン酸型の化合物、好ましくは(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)マロン酸ジエチル、(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)マロン酸ジアリル、(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)マロン酸メチルエチルなどの化合物およびEP - A - 0582198に記載の関連化合物。

【0146】

C) 下記式(S - III)の化合物：

【0147】

【化14】



[式中、記号および指数は下記の意味を有し、

R_C^1 は、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₂ - C₄) - アルケニル、(C₂ - C₄) - ハロアルケニル、(C₃ - C₇) - シクロアルキル、好ましくはジクロロメチルであり；

R_C^2 、 R_C^3 は同一であるか異なっており、水素、(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、(C₁ - C₄) - アルキルカルバモイル - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ - C₄) - アルケニルカルバモイル - (C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ - (C₁ - C₄) - アルキル、ジオキソラニル - (C₁ - C₄) - アルキル、チアゾリル、フリル、フリルアルキル、チエニル、ピペリジル、置換されているまたは置換されていないフェニルであり、または R_C^2 および R_C^3 が一体となって、置換されているまたは置換されていない複素環、好ましくはオキサゾリジン、チアゾリジン、ピペリジン、モルホリン、ヘキサヒドロピリミジンまたはベンゾオキサジン

10

20

30

40

50

環を形成している。】、

好ましくは：

発芽前薬害軽減剤（土壤作用性薬害軽減剤）として使用されるジクロロアセトアミド型の活性化合物、例えば、

「ジクロルミド」（Pestic. Man. 参照）（= N, N - ディアリル - 2, 2 - ディクロロアセトアミド）、

Staufferからの「R - 29148」（= 3 - ディクロロアセチル - 2, 2, 5 - トリメチル - 1, 3 - オキサゾリジン）、

Staufferからの「R - 28725」（= 3 - ディクロロアセチル - 2, 2 - デメチル - 1, 3 - オキサゾリジン）、
10

「ベノキサコール」（Pestic. Man. 参照）（= 4 - ディクロロアセチル - 3, 4 - デヒドロ - 3 - メチル - 2H - 1, 4 - ベンゾオキサジン）、

PPG Industriesからの「PPG - 1292」（= N - アリル - N - [(1, 3 - デオキソラン - 2 - イル) メチル] ディクロロアセトアミド）、

Sagro - Chemからの「DKA - 24」（= N - アリル - N - [(アリルアミノカルボニル) メチル] ディクロロアセトアミド）、

NitrokemiaまたはMonsantoからの「AD - 67」または「MON 4660」（= 3 - ディクロロアセチル - 1 - オキサ - 3 - アザスピロ [4.5] デカン）、

TRI - Chemical RTからの「TI - 35」（= 1 - ディクロロアセチルアゼパン）、
20

「ジクロノン (diclononon)」（ジシクロノン (dicyclonone)）またはBASFからの「BAS 145138」または「LAB 145138」（= 3 - ディクロロアセチル - 2, 2, 5 - トリメチル - 1, 3 - ディアザビシクロ [4.3.0] ノナン）、

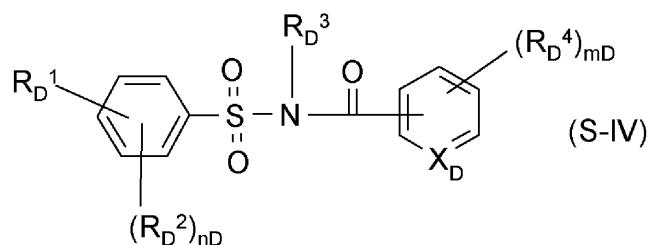
「フリラゾール (furilazole)」または「MON 13900」（Pestic. Man. 参照）（= (RS) - 3 - ディクロロアセチル - 5 - (2 - フリル) - 2, 2 - デメチルオキサゾリジン）。

【0148】

D) 下記式 (S - IV) の N - アシリルスルホンアミド類およびその塩。

【0149】

【化15】



[式中、

X_D は C H または N であり；

R_D^1 は CO - NR_D^5 R_D^6 または NHCO - R_D^7 であり；
40

R_D^2 は、ハロゲン、(C_1 - C_4) - ハロアルキル、(C_1 - C_4) - ハロアルコキシ、ニトロ、(C_1 - C_4) - アルキル、(C_1 - C_4) - アルコキシ、(C_1 - C_4) - アルキルスルホニル、(C_1 - C_4) - アルコキカルボニルまたは(C_1 - C_4) - アルキルカルボニルであり；

R_D^3 は、水素、(C_1 - C_4) - アルキル、(C_2 - C_4) - アルケニルまたは(C_2 - C_4) - アルキニルであり；

R_D^4 は、ハロゲン、ニトロ、(C_1 - C_4) - アルキル、(C_1 - C_4) - ハロアルキル、(C_1 - C_4) - ハロアルコキシ、(C_3 - C_6) - シクロアルキル、フェニル、(C_1 - C_4) - アルコキシ、シアノ、(C_1 - C_4) - アルキルチオ、(C_1 - C_4)
50

- アルキルスルフィニル、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) - アルコキシカルボニルまたは(C₁ - C₄) - アルキルカルボニルであり；

R_D⁵ は、水素、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₆) - アルキニル、(C₅ - C₆) - シクロアルケニル、フェニルまたは窒素、酸素および硫黄からなる群からのv_D個のヘテロ原子を含む3から6員複素環であり、最後に挙げた7種類の基は、ハロゲン、(C₁ - C₆) - アルコキシ、(C₁ - C₆) - ハロアルコキシ、(C₁ - C₂) - アルキルスルフィニル、(C₁ - C₂) - アルキルスルホニル、(C₃ - C₆) - シクロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシカルボニル、(C₁ - C₄) - アルキルカルボニルおよびフェニル、そして環状基の場合にはさらに(C₁ - C₄) - アルキルおよび(C₁ - C₄) - ハロアルキルからなる群からのv_D個の置換基によって置換されており； 10

R_D⁶ は、水素、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニルまたは(C₂ - C₆) - アルキニルであり、最後に挙げた3種類の基はハロゲン、ヒドロキシリ、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシおよび(C₁ - C₄) - アルキルチオからなる群からのv_D個の基によって置換されており、または

R_D⁵ およびR_D⁶ がそれらが有する窒素原子とともに、ピロリジニルまたはピペリジニル基を形成しており；

R_D⁷ は、水素、(C₁ - C₄) - アルキルアミノ、ジ-(C₁ - C₄) - アルキルアミノ、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキルであり、最後に挙げた2種類の基はハロゲン、(C₁ - C₄) - アルコキシ、ハロゲン - (C₁ - C₆) - アルコキシおよび(C₁ - C₄) - アルキルチオ、そしてさらに環状基の場合には(C₁ - C₄) - アルキルおよび(C₁ - C₄) - ハロアルキルからなる群からのv_D個の置換基によって置換されており； 20

n_D は0、1または2であり；

m_D は1または2であり；

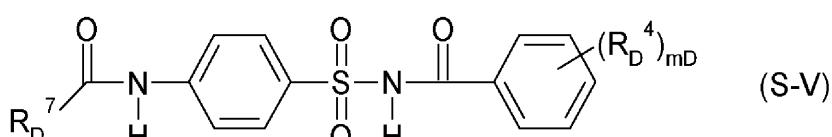
v_D は0、1、2または3である。】。

【0150】

これらのうち、好ましいものは、N - アシルスルホンアミド型の化合物、例えばWO 97 / 45016 から公知である下記の式(S-V)の化合物：

【0151】

【化16】



[式中、

R_D⁷ は、(C₁ - C₆) - アルキル、(C₃ - C₆) - シクロアルキルであり、最後に挙げた2種類の基は、ハロゲン、(C₁ - C₄) - アルコキシ、ハロゲン - (C₁ - C₆) - アルコキシおよび(C₁ - C₄) - アルキルチオ、そして環状基の場合にはさらに(C₁ - C₄) - アルキルおよび(C₁ - C₄) - ハロアルキルからなる群からのv_D個の置換基によって置換されており； 40

R_D⁴ は、ハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、CF₃ であり；

m_D は1または2であり；

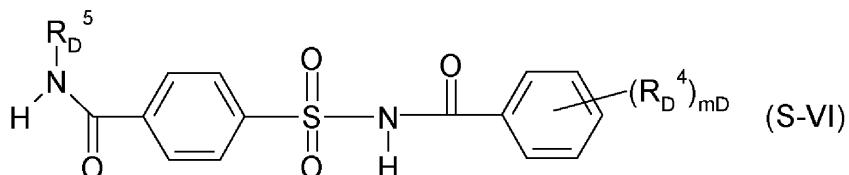
v_D は0、1、2または3である。】

および

例えばWO 99 / 16744 から公知である下記式(S-VI)のアシルスルファモイルベンズアミド類：

【0152】

【化17】



例えば、

R_D^5 = シクロプロピルおよび(R_D^4) = 2 - OMe ('シプロスルファミド'、S 3 - 1)、
10

R_D^5 = シクロプロピルおよび(R_D^4) = 5 - Cl - 2 - OMe (S 3 - 2)、

R_D^5 = エチルおよび(R_D^4) = 2 - OMe (S 3 - 3)、

R_D^5 = イソプロピルおよび(R_D^4) = 5 - Cl - 2 - OMe (S 3 - 4) および

R_D^5 = イソプロピルおよび(R_D^4) = 2 - OMe (S 3 - 5)

であるもの、

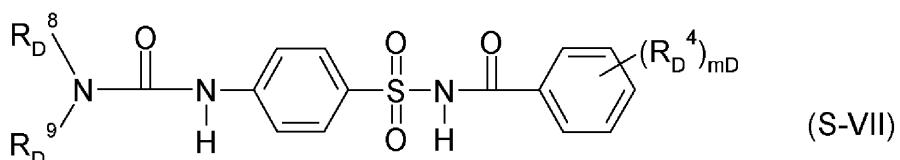
および

例えばEP-A-365484から公知である式(S-VII)のN-アシリルスルファモイルフェニル尿素型の化合物：

【0153】

【化18】

20



[式中、

R_D^8 および R_D^9 は互いに独立に、水素、(C₁ - C₈) - アルキル、(C₃ - C₈) - シクロアルキル、(C₃ - C₆) - アルケニル、(C₃ - C₆) - アルキニルであり、

R_D^4 は、ハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、CF₃ 30 であり、

m_D は1または2である。]；

これらの中では特に、

1 - [4 - (N - 2 - メトキシベンゾイルスルファモイル)フェニル] - 3 - メチル尿素、

1 - [4 - (N - 2 - メトキシベンゾイルスルファモイル)フェニル] - 3 , 3 - ジメチル尿素、

1 - [4 - (N - 4 , 5 - ジメチルベンゾイルスルファモイル)フェニル] - 3 - メチル尿素。

【0154】

40

1 - [4 - (N - ナフトイルスルファモイル)フェニル] - 3 , 3 - ジメチル尿素。

【0155】

G) ヒドロキシ芳香族および芳香族 - 脂肪族カルボン酸誘導体の種類からの活性化合物、例えばWO2004084631、WO2005015994、WO2006007981、WO2005016001に記載の3 , 4 , 5 - トリアセトキシ安息香酸エチル、3 , 5 - ジメトキシ - 4 - ヒドロキシ安息香酸、3 , 5 - ジヒドロキシ安息香酸、4 - ヒドロキシサリチル酸、4 - フルオロサリチル酸、1 , 2 - ジヒドロ - 2 - オキソ - 6 - トリフルオロメチルピリジン - 3 - カルボキサミド、2 - ヒドロキシ桂皮酸、2 , 4 - ジクロロ桂皮酸。

【0156】

50

H) 1 , 2 - ジヒドロキノキザリン - 2 - オンの種類からの活性化合物、例えばWO 2
0 0 5 1 1 2 6 3 0 に記載の

1 - メチル - 3 - (2 - チエニル) - 1 , 2 - ジヒドロキノキザリン - 2 - オン、
1 - メチル - 3 - (2 - チエニル) - 1 , 2 - ジヒドロキノキザリン - 2 - チオン、
1 - (2 - アミノエチル) - 3 - (2 - チエニル) - 1 , 2 - ジヒドロキノキザリン -
2 - オン塩酸塩、
1 - (2 - メチルスルホニルアミノエチル) - 3 - (2 - チエニル) - 1 , 2 - ジヒド
ロキノキザリン - 2 - オン。

【 0 1 5 7 】

I) 有害植物に対する除草作用の他に、イネなどの作物において薬害軽減剤作用も有する活性化合物、例えば、

「ジメピペレート」または「M Y - 9 3 」(P e s t i c . M a n . 参照) (= ピペリジン - 1 - チオカルボン酸 S - 1 - メチル - 1 - フェニルエチル) (イネの除草剤モリネートによる損傷に対する薬害軽減剤として知られている)、

「ダイムロン」または「S K 2 3 」(P e s t i c . M a n . 参照) (= 1 - (1 - メチル - 1 - フェニルエチル) - 3 - p - トリル尿素) (イネの除草剤イマゾスルフロンによる損傷に対する薬害軽減剤として知られている)、

「クミルロン」=「J C - 9 4 0 」(= 3 - (2 - クロロフェニルメチル) - 1 - (1 - メチル - 1 - フェニル - エチル) 尿素 (J P - A - 6 0 0 8 7 2 5 4 参照、イネの多くの除草剤による損傷に対する薬害軽減剤として知られている)、

「メトキシフェノン」または「N K 0 4 9 」(= 3 , 3 - ジメチル - 4 - メトキシベンゾフェノン) (イネの多くの除草剤による損傷に対する薬害軽減剤として知られている)、

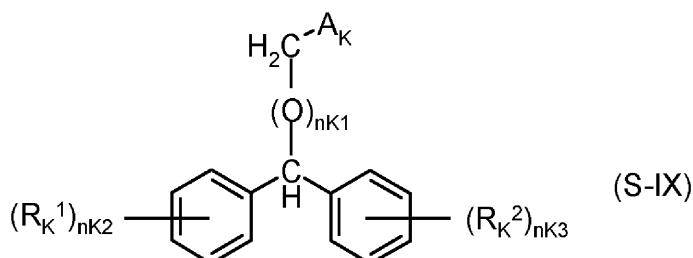
「C S B 」(= 1 - ブロモ - 4 - (クロロメチルスルホニル) ベンゼン) (C A S 登録番号 5 4 0 9 1 - 0 6 - 4 、K u m i a i 社) (イネの多くの除草剤による損傷に対する薬害軽減剤として知られている)。

【 0 1 5 8 】

K) W O - A - 1 9 9 8 / 3 8 8 5 6 に記載の下記式 (S - I X) の化合物：

【 0 1 5 9 】

【 化 1 9 】



[式中、記号および指数は下記の意味を有し、

R_K¹、R_K² は、互いに独立に、ハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄) - アルキルアミノ、ニトロであり；

A_K は、COOR_K³ またはCOOR_K⁴ であり；

R_K³、R_K⁴ は、互いに独立に、水素、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、(C₂ - C₄) - アルキニル、シアノアルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、フェニル、ニトロフェニル、ベンジル、ハロベンジル、ピリジニルアルキルまたはアルキルアンモニウムであり；

n_K¹ は、0 または 1 であり；

n_K²、n_K³ は、互いに独立して、0、1 または 2 である。]、

好ましくは、(ジフェニルメトキシ)酢酸メチル (C A S 登録番号 4 1 8 5 8 - 1 9 -

10

20

30

40

50

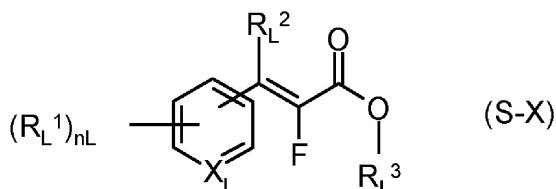
9)。

【0160】

L) WO A - 98 / 27049 に記載の下記式 (S-X) の化合物：

【0161】

【化20】



[式中、記号および指数は下記の意味を有し、

X_L は、C H または N であり；

n_L は、

X = N である場合、0 から 4 の整数であり、

X = C H である場合、0 から 5 の整数であり；

R_L¹ は、ハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、(C₁ - C₄) - ハロアルキル、(C₁ - C₄) - アルコキシ、(C₁ - C₄) - ハロアルコキシ、ニトロ、(C₁ - C₄) - アルキルチオ、(C₁ - C₄) - アルキルスルホニル、(C₁ - C₄) - アルコキシカルボニル、置換されていても良いフェニル、置換されていても良いフェノキシであり；

R_L² は、水素または(C₁ - C₄) - アルキルであり；

R_L³ は、水素、(C₁ - C₈) - アルキル、(C₂ - C₄) - アルケニル、(C₂ - C₄) - アルキニルまたはアリールであり、ここで、上記の炭素含有基の各々は、置換されていないか 1 個以上の、好ましくは 3 個以下のハロゲンおよびアルコキシからなる群からの同一もしくは異なる基により置換されている。]；またはその塩。

【0162】

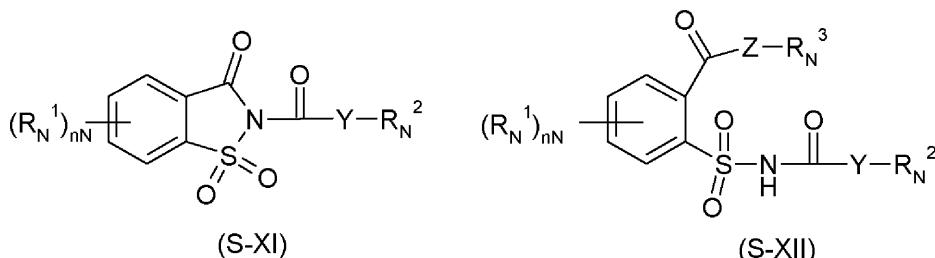
M) 3 - (5 - テトラゾリルカルボニル) - 2 - キノロン類の活性化合物、例えば、1, 2 - ジヒドロ - 4 - ヒドロキシ - 1 - エチル - 3 - (5 - テトラゾリルカルボニル) - 2 - キノロン (CAS 登録番号 219479 - 18 - 2)、1, 2 - ジヒドロ - 4 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 3 - (5 - テトラゾリルカルボニル) - 2 - キノロン (CAS 登録番号 95855 - 00 - 8) (WO - A - 1999000020 に記載)。

【0163】

N) WO - A - 2007023719 および WO - A - 2007023764 に記載の下記式 (S-XI) または (S-XII) の化合物：

【0164】

【化21】



[式中、

R_N¹ は、ハロゲン、(C₁ - C₄) - アルキル、メトキシ、ニトロ、シアノ、CF₃、OCF₃ であり；

Y、Z は、互いに独立に、O または S であり；

n_N は、0 から 4 の整数であり；

R_N² は、(C₁ - C₁₆) - アルキル、(C₂ - C₆) - アルケニル、(C₃ - C₆)

50

) - シクロアルキル、アリール、ベンジル、ハロベンジルであり；

R_N^3 は、水素、(C₁ - C₆)アルキルである。】。

【0165】

O)

1 , 8 - ナフタル酸無水物、

ジチオリン酸O , O - ジエチルS - 2 - エチルチオエチル(ジスルホトン)、

メチル4 - クロロフェニルカーバメート(メフェナート)、

チオリン酸O , O - ジエチルO - フェニル(ジエトラート)、

4 - カルボキシ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 - ベンゾピラン - 4 - 酢酸(CL - 30

4415、CAS登録番号31541 - 57 - 8)、

10

1 - オキサ - 4 - アザスピロ[4 . 5]デカン - 4 - カルボジチオ酸2 - プロペニル(MG - 838、CAS登録番号133993 - 74 - 5)、

[(3 - オキソ - 1 H - 2 - ベンゾチオピラン - 4 (3H) - イリデン) メトキシ] 酢酸メチル(WO - A - 98 / 13361より; CAS登録番号205121 - 04 - 6)

、

シアノメトキシイミノ(フェニル)アセトニトリル(シオメトリニル)、

1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イルメトキシイミノ(フェニル)アセトニトリル(オキサベトリニル)、

4 - クロロ - 2 , 2 , 2 - トリフルオロアセトフェノンO - 1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イルメチルオキシム(フルキソフェニム)、

20

4 , 6 - ジクロロ - 2 - フェニルピリミジン(フェンクロリム)、

2 - クロロ - 4 - トリフルオロメチル - 1 , 3 - チアゾール - 5 - カルボン酸ベンジル(フルラゾール)、

2 - ジクロロメチル - 2 - メチル - 1 , 3 - ジオキソラン(MG - 191)

からなる群からの1以上の化合物(立体異性体を含む)および農業で一般的な塩。

【0166】

殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、鳥忌避剤、植物栄養剤および土壤改良剤などの他の公知の活性化合物と組み合わせて、(I)(a)カラスマギ属、好ましくはカラスマギ(Avenasativa)、より好ましくは配列番号2によって定義されるHPPDをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b)シュードモナス(Pseudomonas)、好ましくは蛍光菌(Pseudomonasfluorescens)、より好ましくは配列番号4によって定義されるHPPDをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c)シネココッコイデアエ(Synechococcoidae)、好ましくはシネココッカス(Synechococcus)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるHPPDをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d)アミカ(Blepharismaidae)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム(Blepharismajaponicum)、より好ましくは配列番号9によって定義されるHPPDをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e)ロドコッカス(Rhodococcus)、好ましくはロドコッカス(Rhodococcus)属種(RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(Rhodococcus)属種(RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(Picrophilaceae)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(Picrophilustorridus)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(Kordia)、好ましくはコルディア・アルギシダ(Kordialalgicida)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(

30

(RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(Rhodococcus)属種(RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(Picrophilaceae)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(Picrophilus torridus)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(Kordia)、好ましくはコルディア・アルギシダ(Kordialalgicida)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(

40

(RHA1株)、分離株r003041、より好ましくは配列番号11によって定義されるHPPDをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(Rhodococcus)属種(RHA1株)、分離株r002040、より好ましくは配列番号13によって定義されるHPPDをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f)ピクロフィルス科(Picrophilaceae)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(Picrophilus torridus)、より好ましくは配列番号15によって定義されるHPPDをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g)コルディア(Kordia)、好ましくはコルディア・アルギシダ(Kordialalgicida)、より好ましくは配列番号17によって定義されるHPPDをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の構成員由来のヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(

50

H P P D) をコードするDNA配列を含み、または(I I) 前記で定義の生物のH P P D をコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO 2 0 1 0 / 0 8 5 7 0 5、U S 6 , 2 4 5 , 9 6 8、W O 2 0 0 9 / 1 4 4 0 7 9、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 6 1、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 6 7、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 8、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 0、またはP C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 5に記載の突然変異体を含む1以上のキメラ遺伝子を含むトランスジェニック植物に施用される上記で定義のN - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくはN - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類もしくはそれらの塩の混合物の同様に可能である。

【 0 1 6 7 】

一部の薬害軽減剤がすでに除草剤として知られていることから、有害植物に対する除草作用の他に、さらに作物に保護作用を示す。除草剤(混合物)の薬害軽減剤に対する重量比は、一般的に、除草剤施用量および対象の薬害軽減剤の有効性によって決まるものであり、広い範囲で変動させることができ、例えば、2 0 0 : 1 から 1 : 2 0 0 、好ましくは1 0 0 : 1 から 1 : 1 0 0 、特には2 0 : 1 から 1 : 2 0 の範囲である。薬害軽減剤は、式(I) の化合物またはその混合物と同様に、他の除草剤/農薬と共に製剤してもよく、そして、最終製剤または除草剤とのタンクミックスとして提供および使用することができる。

【 0 1 6 8 】

(I) (a) カラスマムギ属、好ましくはカラスマギ(*A v e n a s a t i v a*)、より好ましくは配列番号2によって定義されるH P P Dをコードする配列番号1と同一のDNA配列を含むもの、(b) シュードモナス(*P s e u d o m o n a s*)、好ましくは蛍光菌(*P s e u d o m o n a s f l u o r e s c e n s*)、より好ましくは配列番号4によって定義されるH P P Dをコードする配列番号3と同一のDNA配列を含むもの、(c) シネコッコイデアエ(*S y n e c h o c o c c o i d e a e*)、好ましくはシネコッカス(*S y n e c h o c o c c u s*)属種、より好ましくは配列番号7によって定義されるH P P Dをコードする配列番号6と同一のDNA配列を含むもの、(d) アミカ(*B l e p h a r i s m i d a e*)、好ましくはブレファリスマ・ジャポニクム(*B l e p h a r i s m a j a p o n i c u m*)、より好ましくは配列番号9によって定義されるH P P Dをコードする配列番号8と同一のDNA配列を含むもの、(e) ロドコッカス(*R h o d o c o c c u s*)、好ましくはロドコッカス(*R h o d o c o c c u s*)属種(R H A 1 株)、分離株r o 0 3 0 4 1 、より好ましくは配列番号11によって定義されるH P P Dをコードする配列番号10と同一のDNA配列またはロドコッカス(*R h o d o c o c c u s*)属種(R H A 1 株)、分離株r o 0 2 0 4 0 、より好ましくは配列番号13によって定義されるH P P Dをコードする配列番号12と同一のDNA配列を含むもの、(f) ピクロフィルス科(*P i c r o p h i l a c e a e*)、好ましくはピクロフィルス・トリズス(*P i c r o p h i l u s t o r r i d u s*)、より好ましくは配列番号15によって定義されるH P P Dをコードする配列番号14と同一のDNA配列を含むもの、(g) コルディア(*K o r d i a*)、好ましくはコルディア・アルギシダ(*K o r d i a a l g i c i d a*)、より好ましくは配列番号17によって定義されるH P P Dをコードする配列番号16と同一のDNA配列を含むものからなる生物の群の1構成員由來の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)をコードするDNA配列を含み、または(I I) 前記で定義の生物のH P P Dをコードする遺伝子の1以上の突然変異DNA配列、好ましくはWO 2 0 1 0 / 0 8 5 7 0 5、U S 6 , 2 4 5 , 9 6 8、W O 2 0 0 9 / 1 4 4 0 7 9、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 6 1、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 6 7、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 8、P C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 0、またはP C T / E P 2 0 1 0 / 0 7 0 5 7 5に記載の突然変異体を含む1以上のキメラ遺伝子を含むそのようなトランスジェニック植物の区域への上記で定義のN - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくはN - (トリアゾール - 3 - イル) アリールカルボキサミド類の必要な施用量は、特には外的条件、例えば温度、湿度および使用される除草剤の種類に応じて変わるものである。それは、広い範囲内で変動し得るものであり、例えば0

10

20

30

40

50

.001から10000g/haまたはそれ以上の活性物質が、好ましくは、0.5から5000g/ha、特に好ましくは0.5から1000g/ha、非常に特に好ましくは0.5から500g/haである。

【0169】

配列表

配列番号1：大腸菌細胞における発現に至適化されたカラスムギ(*Avena sativa*)HPPDをコードする核酸配列

配列番号2：配列番号1によってコードされたタンパク質

配列番号3：位置336で突然変異した蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)HPPDをコードする核酸配列；突然変異Gly=>Trp 10

配列番号4：配列番号3によってコードされたタンパク質

配列番号5：位置336で突然変異した蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)HPPDをコードする核酸配列；突然変異Gly=>Trp；ダイズおよびワタでの発現に至適化されたもの

配列番号6：シネココッカス(*Synechococcus*)属種HPPDをコードする核酸配列

配列番号7：配列番号6によってコードされたタンパク質

配列番号8：ブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)HPPDをコードする核酸配列

配列番号9：配列番号8によってコードされたタンパク質 20

配列番号10：ロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(株RHA1)、分離株ro03041HPPDをコードする核酸配列

配列番号11：配列番号10によってコードされたタンパク質

配列番号12：ロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(株RHA1)、分離株ro02040HPPDをコードする核酸配列

配列番号13：配列番号12によってコードされたタンパク質

配列番号14：ピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)HPPDをコードする核酸配列

配列番号15：配列番号14によってコードされたタンパク質

配列番号16：コルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)HPPDをコードする核酸配列 30

配列番号17：配列番号16によってコードされたタンパク質

配列番号18：ダイズおよびワタでの発現に至適化されたシネココッカス(*Synechococcus*)属種HPPDをコードする核酸配列

配列番号19：ダイズおよびワタでの発現に至適化されたブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)HPPDをコードする核酸配列

配列番号20：ダイズおよびワタでの発現に至適化されたロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(株RHA1)、分離株ro0341HPPDをコードする核酸配列

配列番号21：ダイズおよびワタでの発現に至適化されたロドコッカス(*Rhodococcus*)属種(株RHA1)、分離株ro0240HPPDをコードする核酸配列 40

配列番号22：ダイズおよびワタでの発現に至適化されたピクロフィルス・トリズス(*Picrophilus torridus*)HPPDをコードする核酸配列

配列番号23：ダイズおよびワタでの発現に至適化されたコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)HPPDをコードする核酸配列。

【0170】

I. 各種生物からのHPPDをコードする特異的遺伝子のクローニング

A. カラスムギ属(*Avena*)HPPDのクローニング(WO02/46387による)

A1 - 大腸菌細胞での発現のためのクローニング

カラスムギ(*Avena sativa*)HPPD(AvHPPD；配列番号1)をコ 50

ードするcDNAを、大腸菌細胞での遺伝子発現に至適化されたコドン使用頻度を用いて、GeneArt (Regensburg、ドイツ)で発注した。開始コドンATGの上流で、制限酵素BamHIの認識部位に相当する配列を付加し、停止コドンの下流で、酵素 HindIII の認識部位に相当する配列ストレッチを付加した。予め開いておいたベクター pET32a (Novagen, Darmstadt, Germany)において制限酵素BamHIおよびHindIIIを用いて合成断片をクローニングすることで、AvHPPDタンパク質(配列番号2)からのN末端先端のベクターに存在するHistagとの融合を得た。得られたベクターは、pET32a-AvHPPDeと称した。

【0171】

そのタンパク質を大腸菌で産生させ、標準的なプロトコール(例えばWO2009/144097に記載のもの)に従って単離した。 10

【0172】

A2-タバコ植物での発現のためのpBin19バイナリーベクターでのAvHPPD遺伝子のクローニング

AvHPPDタンパク質をコードする遺伝子に相当するcDNAを、制限酵素NcoIおよびNotIを用いてプラスミドpET32a-AvHPPDeから切り取った。NotI制限から得られたオーバーハング配列を埋め、次に、得られた断片を酵素NcoIおよびSmaIで予め制限しておいたベクターpRT100-OTPcにクローニングした(例えばTopfer (1987), Nucleic Acids Res. 15: 5890およびPCT/EP2010/070561参照)。このベクターにおいて、AvHPPDをコードする配列は、タンパク質の葉緑体への転座を行う至適化された輸送ペプチドに相当する配列に対して下流に位置しており、後者の配列自体がCaMV35Sプロモーターに相当する配列の下流である(例えばWO2009/144097参照)。発現カセットCaMV35S-OTPc-AvHPPDe-35Sに相当するヌクレオチド配列を、酵素SbfIを用いて制限し、同じ酵素で予め開いておいたベクターpBin19にさらにクローニングした。得られたプラスミドはpBin19-CaMV35S-OTPc-AvHPPDe-35Sと称し、それを用いてアグロバクテリウム・ツメファシエンス(Agrobacterium tumefaciens)株ATHVの形質転換を行った(例えばPCT/EP2010/070561参照)。 20

【0173】

B.PfHPPD-G336Wのクローニング

B1-大腸菌細胞での発現のためのPfHPPD-G336Wのクローニング

プラスミドpKK233-2 (Clontech) (US6245968)における蛍光菌(Pseudomonas fluorescens)からの突然変異体HPPDG336W(配列番号3) (US6,245,968)をコードする遺伝子を、PCRがそれの5'先端でその配列に、酵素NcoIの認識部位に相当する配列を、その3'先端で、酵素XbaIの認識部位に相当する配列を付加するための鋸型として用いた(WO2009/144079参照)。そのクローニングを行って、「pSE420(RI)NX-PfG336W」という名称のショードモナス(Pseudomonas)HPPDG336W(配列番号4)のN末端先端でHistag融合タンパク質を得た。 40

【0174】

B2-タバコ植物pFCO117における発現のためのPfHPPD-G336Wのクローニング

タバコもしくはダイズ形質転換用のバイナリーベクターは、例えば双子葉植物での発現に至適化されたコドン使用頻度を有する遺伝子PfHPPD-G336W(配列番号5)の発現を駆動するCaMV35Sプロモーターで構築され、その5'先端で、OTPをコードする配列を付加し、さらに上流で植物におけるmRNAの安定性を向上させるための配列TEV(タバコエッチャウィルス)と次にCaMV35Sターミネーターを付加した。さらに、その形質転換ベクターはさらに、遺伝子がCaVM35Sプロモーターによって駆動されるPAT遺伝子カセットを含み、次に形質転換プロセス中のグルホシネットに基づ

づく選択のための CaMV 35S ターミネーターおよび遺伝子がアラビドプシス (Arabidopsis) からのヒストンプロモーターによって駆動されて形質転換植物に除草剤グリホセートに対する耐性を与える pSE420 (R I) NX - FMP37 遺伝子カセットを含む。そのバイナリーベクターは、pFCO117 と称した。

【0175】

C. 大腸菌もしくはタバコ植物での発現のためのブレファリスマ (Blepharisma) およびコルディア (Kordia) から得られる HPPD のクローニング

これらのクローニングは、PCT / EP 2010 / 070567 (ブレファリスマ・ジヤポニクム (Blepharisma japonicum) 、FMP37、実施例 1、「pSE420 (R I) NX - FMP37」と称される) および PCT / EP 2010 / 070575 (コルディア・アルギシダ (Kordia algicida) 、FMP27、実施例 1、「pSE420 (R I) NX - FMP27」と称される) に記載の方法に従って行った。

【0176】

D - 大腸菌での HPPD タンパク質の产生、His - Tag を介した精製

アラビドプシス・タリアナ (Arabidopsis thaliana) AtHPPD コード配列 (1335 bp; Genbank AF047834; WO96/38567) を最初に、BamHI および HindIII の制限部位間で発現ベクター pQE-30 (QIAGEN, Hilden, Germany) にクローニングした。得られたベクターは、「pQE30 - AtHPPD」と称した (WO2009/144079 参照)。

【0177】

そのプラスミドは、trp - lac (trc) プロモーターおよびあらゆる大腸菌宿主株で lacI リプレッサーを提供する lacI^q 遺伝子を有する。 lacI リプレッサーは、lacI オペレーター (lacO) に結合し、標的遺伝子の発現を制限する。この阻害は、イソプロピル - D - 1 - チオガラクトピラノシド (IPTG) での誘発によって軽減することができる。

【0178】

上記で定義の全ての大腸菌発現ベクターを用いて、大腸菌 BL21 細胞 (Merck, Darmstadt, Germany) の形質転換を行った。

【0179】

基準として用いた AtHPPD (アラビドプシス・タリアナ (Arabidopsis thaliana) HPPD) については、WO2009/144079 を参照する。

【0180】

pQE30 - AtHPPD、pET32a - AvHPPD e、pSE420 (R I) NX - PfG336W、pSE420 (R I) NX - FMP27 もしくは pSE420 (R I) NX - FMP37 を含む大腸菌 K - 12 BL21 で、HPPD の発現を行った。OD が 0.5 に達するまで細胞を増殖させ、次に lacI リプレッサーに結合し、lacI オペロンからのそれの解離を生じさせる 1 mM IPTG による誘発によって、trp - lac (trc) プロモーターから発現を開始した。発現は、28 で 15 時間かけて行った。

【0181】

前スター培養液を調製するため、TB 培地 ($100 \mu g * mL^{-1}$ カルベニシリン) 2 mL に、大腸菌 K - 12 BL21 グリセロール原液 50 μL を接種した。前スター培養液を、140 rpm で 15 時間振盪しながら 37 度インキュベートした。前スター培養液 200 μL を用いて、スター培養 ($100 \mu g * L^{-1}$ で TB 補充 5 mL) を開始し、それを 37 度 3 時間インキュベートした。

【0182】

主培養液を調製するため、TB 培地 ($100 \mu g * mL^{-1}$ カルベニシリン) 400 mL に、スター培養液 4 mL を接種した。このスター培養液を、OD₆₀₀ 0.5 に達するまで 140 rpm で振盪しながら 37 度インキュベートした。次に、組換え

10

20

30

40

50

タンパク質発現を、1M IPTG 溶液 400 μL で誘発した。これらの条件下に細胞をさらに1時間増殖させ、次に温度を下げる 28 ℃ とし、培養液を 140 rpm で 15 時間振盪した。6000 × g で 15 分間 4 ℃ にて遠心することで細胞を回収した。次に、細胞ペレットを -80 ℃ で保存した。

【0183】

天然型での His₆-AthPPD、His₆-AvHPPD、His₆-PfHPPD-G336W、His₆-FMP27 および His₆-FMP37 の単離および精製
細胞の溶解

細菌細胞壁を形成するペプチドグリカンで N - アセチルムラミン酸と N - アセチル - D - グルコサミン残基との間の 1, 4 - β - 連絡を開裂させる酵素であるリゾチームを用いて細胞を溶解した。次に、細菌細胞の内部圧力によって細胞膜を破壊した。さらに、溶菌緩衝液には、タンパク質に損傷を与えることなく全ての形態の DNA および RNA を加水分解することで、細胞溶解物の粘度を大幅に低下させるエンドヌクレアーゼであるベンゾナーゼ (Benzonase) (登録商標) ヌクレアーゼを含有させた。自然条件下での溶菌を、氷上で行った。

【0184】

His₆ 標識タンパク質の精製のため、QIAexpress (登録商標) Ni - NTA Fast Start Kit をユーザーマニュアルの説明に従って用いた。

【0185】

固定化金属イオンアフィニティクロマトグラフィー (IMAC) による His₆ 標識タンパク質の精製
20

溶解反応物の遠心後に得られた透明細胞溶解物 (10 mL) を、QIAexpress (登録商標) Ni - NTA Fast Start Kit (Qiagen, Hilden, Germany) からの Ni - NTA Fast Startカラムに負荷し、使用説明書に従って精製を行った。溶離緩衝液 2.5 mL で His₆ 標識タンパク質を溶離した。

【0186】

ゲルfiltrationによるHPPD溶液の脱塩

溶離緩衝液 2.5 mL で Ni - NTA Fast Start カラムから溶離した HPPD 溶液を、ユーザーマニュアルの説明に従って Sephadex G - 25 PD - 10 カラム (GE Healthcare, Freiburg, Germany) に負荷した。サンプル全体がゲル床に入った後、貯蔵緩衝液 3.5 mL を用いて溶離を行った。

【0187】

脱塩カラムから溶離した HPPD 溶液を、小分けサンプル 1 mL 中 -80 ℃ で冷凍した。
。

【0188】

ブラッドフォード (Bradford) タンパク質アッセイを用いる HPPD タンパク質濃度の測定

標準的なブラッドフォードアッセイ (Bradford, (1976), Anal Biochem 72: 248 - 254) を用いて、タンパク質濃度を求めた。

【0189】

SDS-PAGE を用いる HPPD 溶液の純度の測定

ゲル NuPAGE (登録商標) Novex 4 - 12% Bis - Tris Gels (Invitrogen, Karlsruhe, Germany) を用いる SDS-PAGE タンパク質ゲル電気泳動によって溶離したタンパク質の完全性を調べ、タンパク質約 10 μg を負荷した。Laemmli サンプル緩衝液 10 μL をタンパク質溶液 1 から 10 μL に加え、混合物を 90 ℃ で 10 分間インキュベートした。短い遠心段階後、混合物全体を、NuPAGE (登録商標) MOPS SDS 泳動干渉液 (ddH₂O で 20 倍溶液から希釈) を充填した XCell SureLock (商標名) Novex Mini - Cell ゲルチャンバにおいて固定しておいた SDS ゲルのスロットに負荷した。次に、ゲル

10

20

30

40

50

ルチャンバに電圧150を1時間印加した。タンパク質帯域を染色するため、ゲルをCoomassie Brilliant Blue R-250染色溶液に浸漬した。ポリアクリルアミドゲルの脱染を行うため、タンパク質帯域が白色ゲル上で青色に見えるまで、それをCoomassie Brilliant Blue R-250脱染溶液に浸漬した。

【0190】

HPPD酵素のHPPD阻害薬に対する耐性の評価

HPPD活性を、標準的な分光学的アッセイ(WO2009/144079に詳細に記載されている方法)によってチェックした。

【0191】

E-HPPD阻害薬型除草剤に対する耐性の評価

いくつかのHPPD阻害薬存在下でのHPPD活性の測定

異なる生物から得られるHPPDタンパク質の耐性のレベルを、PCT/EP2010/070575に記載の手順に従って求めた。

【0192】

下記表E1で、コルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*) (FMP27)、ブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*) (FMP37)、カラスムギ(*Avena sativa*) (AvHPPD)から、そして蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)からの突然変異HPPD-G336Wから得られたHPPDが、同じ実験条件下での全ての被験HPPD阻害薬濃度でアラビドプシス・タリアナ(*Arabidopsis thaliana*)HPPD(AtHPPD)と比較して、全ての被験HPPD阻害薬に対して高いレベルの耐性を示したことが明らかである。

【0193】

表E1:アラビドプシス・タリアナ(*Arabidopsis thaliana*) (AtHPPD)、突然変異蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*) PfHPPD-G336W、カラスムギ(*Avena sativa*) (AvHPPD)、FMP27(コルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)由来)およびFMP37(ブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)由来)由来のHPPDでの化合物番号「4-137」非存在下で測定される活性と比較した、 5.0×10^{-6} Mの化合物「4-137」存在下での阻害パーセントの測定

表E1化合物「4-137」

【0194】

【表9】

タンパク質	阻害%
AtHPPD	100
PfHPPD-G336W	92
AvHPPD	93
FMP27	90
FMP37	82

これらのデータは、化合物「4-137」について示されたように、アラビドプシス・タリアナ(*Arabidopsis thaliana*)由来のHPPDで観察される阻害と比較して、コルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)、ブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)、カラスムギ(*Avena sativa*)および蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)の突然変異体HPPD-G336W由来のHPPDが、N-(テトラゾール-4

10

20

30

40

50

- イル) - もしくはN - (トリアゾール - 3 - イル)アリールカルボキサミドに対して感受性が低いことを示している。

【0195】

F - 耐性HPPD酵素を発現するタバコ植物のHPPD阻害薬に対する耐性の評価 選択されたHPPDをコードする遺伝子を、カラスムギ(*Avena sativa*)、蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)突然変異体G336W、ブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*)およびコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)からなる生物の群の1員から得て、CAMV35Sプロモーターの制御下にタバコゲノムへのDNAの組み込みを可能とするバイナリーベクターpBin19にクローニングした。そのクローニング手順については、カラスムギ(*Avena sativa*)に関しては上記のA2を、蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)突然変異体G336Wに関しては上記のB2を、ブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*) (FMP37)についてはPCT/EP2010/070567 (WO2011/076882として公開)実施例5を、そしてコルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*) (FMP27)についてはPCT/EP2010/070575、実施例5を参照する。プロモーターに相当する配列とHPPDをコードする配列の間で、葉緑体への輸送ペプチドをコードするDNA配列を挿入して、タンパク質のN末端先端で標的シグナルを負荷して、植物葉緑体へのHPPDタンパク質の局在化を可能とした。T0形質転換体から収穫した種子は、発芽のための標準的な土壤の上に置く。3週間後、小植物(T1)を単一ポットに移し、標準的な条件下で成長させる (PCT/EP2010/070575、WO2011/076889として公開)。2週間後、植物に上記で定義のいくつかのN - (テトラゾール - 4 - イル) - もしくはN - (トリアゾール - 3 - イル)アリールカルボキサミド類を噴霧した。例えば、化合物「5 - 148」、「4 - 137」、「4 - 253」、「4 - 278」および「4 - 25」を施用してから1週間後に、除草剤の施用による症状を評価したところ、トランスジェニック植物は下記の表F1からF5にそれぞれ示された良好な耐性を示した。
10
20

【0196】

表F1からF5：非形質転換タバコ植物(「wt」)と比較した、突然変異体蛍光菌(*Pseudomonas fluorescens*)HPPDG336W、カラスムギ属(*Avena*)HPPD(AvHPPD)、コルディア・アルギシダ(*Kordia algicida*)FMP27からのHPPDまたはブレファリスマ・ジャポニクム(*Blepharisma japonicum*) (FMP37)からのHPPDを発現するトランスジェニックタバコ植物に対する除草剤の施用により認められる症状の評価
30

除草剤(「gAI/ha」は「有効成分g / ha」を意味する)を、導入遺伝子当たり1から3の独立のトランスジェニックイベント由来の8から10の植物に施用した。

【0197】

症状を評価し、下記のように分類した。

【0198】

3 = 非常に強い損傷

2 = 強い損傷

1 = 軽度および一時的損傷

0 = 損傷なし。

【0199】

表F1

化合物「5 - 148」(WP20製剤)を2リットル/haアブラナメチルエステルおよび1kg/ha硫酸アンモニウムと混合し、次に標準的な除草剤噴霧機を用いて25g AI/haの施用量でトランスジェニック植物に施用した。

【0200】

【表 1 0】

HPPD	損傷				
	系統	0	1	2	3
Wt		0	0	0	10
PfHPPD-G336W	646	0	3	2	4
AvHPPD	656	2	1	3	4
	659	3	1	0	6
	699	1	1	1	7
FMP27	733	3	1	4	2
	734	4	2	0	4
	735	0	4	4	2
FMP37	749	2	3	2	3
	754	2	1	5	2
	795	1	0	6	3

表 F 2

化合物「4 - 1 3 7」；25 g / ha (WP20 製剤) を 2 リットル / ha アブラナメチルエステルおよび 1 kg / ha 硫酸アンモニウムと混合し、次に標準的な除草剤噴霧機を用いて 25 g AI / ha の施用量でトランスジェニック植物に施用した。

【0201】

【表 1 1】

10

HPPD	損傷				
	系統	0	1	2	3
Wt		0	0	0	10
PfHPPD-G336W	646	5	2	0	3
AvHPPD	656	3	1	1	5
	659	3	3	0	4
	699	1	2	0	7
FMP27	733	4	0	1	5
	734	5	2	0	3
	735	3	0	4	3
FMP37	749	8	2	0	0
	754	0	1	1	8
	795	2	0	2	6

20

表 F 3

化合物「4 - 2 5 3」；50 g / ha (WP20 製剤) を 2 リットル / ha ア布拉ナメチルエステルおよび 1 kg / ha 硫酸アンモニウムと混合し、次に標準的な除草剤噴霧機を用いて 50 g AI / ha の施用量でトランスジェニック植物に施用した。

【0202】

40

【表 1 2】

HPPD	損傷			
系統	0	1	2	3
Wt	0	0	0	10
PfHPPD-G336W	646	9	0	0
AvHPPD	659	3	0	0
FMP27	733	4	2	0
	734	6	1	2
	735	2	5	0
FMP37	749	7	2	0
	754	6	2	1
	795	3	4	0

10

表 F 4

化合物「4 - 278」；50 g / ha (WP20 製剤) を 2 リットル / ha アブラナメチルエステルおよび 1 kg / ha 硫酸アンモニウムと混合し、次に標準的な除草剤噴霧機を用いて 50 g AI / ha の施用量でトランスジェニック植物に施用した。

【0203】

【表 1 3】

HPPD	損傷			
系統	0	1	2	3
Wt	0	0	0	10
PfHPPD-G336W	646	6	3	0
AvHPPD	659	9	0	0
FMP27	733	6	4	0
	734	6	3	0
	735	6	2	0
FMP37	749	5	4	0
	754	5	4	0
	795	4	3	0

20

30

表 F 5

化合物「4 - 25」；50 g / ha (WP20 製剤) を 2 リットル / ha ア布拉ナメチルエステルおよび 1 kg / ha 硫酸アンモニウムと混合し、次に標準的な除草剤噴霧機を用いて 50 g AI / ha の施用量でトランスジェニック植物に施用した。

【0204】

【表 1 4】

HPPD	損傷			
系統	0	1	2	3
Wt	0	0	0	10
PfHPPD-G336W	646	10	0	0
AvHPPD	659	6	1	0
FMP27	733	9	1	0
	734	6	3	0
	735	5	3	0
FMP37	749	8	0	0
	754	3	5	1
	795	7	0	1

40

これらのデータは、コルディア・アルギシダ (Kordia algicida)、ブ

50

レファリスマ・ジャポニクム (*Blepharisma japonicum*)、カラスムギ (*Avena sativa*) および蛍光菌 (*Pseudomonas fluorescens*) HPPDの突然変異体「G336W」由来のHPPDを発現する全ての被験独立系統のタバコ植物が、化合物「5-148」、「4-137」、「4-253」、「4-278」および「4-25」について示された野生型 (wt) 植物と比較して、N- (テトラゾール-4-イル) - もしくはN- (トリアゾール-3-イル) アリールカルボキサミドに対して農学的に妥当な用量で感受性が低いことを示している。

【0205】

G-耐性HPPD酵素、蛍光菌 (*Pseudomonas fluorescens*) 「G336W」突然変異体、FMP27およびFMP37を発現するダイズ植物のHPPD阻害薬に対する耐性の評価 10

選択されたHPPDをコードする遺伝子を、ブレファリスマ・ジャポニクム (*Blepharisma japonicum*) およびコルディア・アルギシダ (*Kordia algicida*) からなる生物の群の1員から得て、CaMV35Sプロモーターの制御下にダイズゲノムへのDNAの組み込みを可能とする適切なバイナリーベクターにクローニングした。その個々のクローニング手順については、ブレファリスマ・ジャポニクム (*Blepharisma japonicum*) (FMP37) についてはWO2011076882 (PCT/EP2010/070567) 実施例9を、そしてコルディア・アルギシダ (*Kordia algicida*) (FMP27) についてはWO2011076889 (PCT/EP2010/070575) 実施例9を参照する。 20

【0206】

プロモーターに相当する配列とHPPDをコードする配列の間で、葉緑体への輸送ペプチドをコードするDNA配列を挿入して、タンパク質のN末端先端で標的シグナルを負荷して、植物葉緑体へのHPPDタンパク質の局在化を可能とした。ベクター「pFCO112」(ブレファリスマ・ジャポニクム (*Blepharisma japonicum*))、WO2011076882)、pFCO116 (コルディア・アルギシダ (*Kordia algicida*))、WO2011076889) および「pFCO117」(上記実施例B2参照)を用いることで、ブレファリスマ・ジャポニクム (*Blepharisma japonicum*) (FMP37) についてはWO2011076882 (PCT/EP2010/070567) の実施例10およびコルディア・アルギシダ (*Kordia algicida*) (FMP27) についてはWO2011076889 (PCT/EP2010/070575) に記載の方法に従って、ダイズの形質転換を行った。テンボトリオンに対する耐性を示すT0イベントからの種子を収穫した。 30

【0207】

T1ダイズ種子を单一ポットに移し、標準的な条件下で成長させた (WO2011076882参照)。

【0208】

2週間後、植物に上記で定義のいくつかのN- (テトラゾール-4-イル) - もしくはN- (トリアゾール-3-イル) アリールカルボキサミド類を噴霧する。例えば、化合物「5-148」、「4-137」、「4-253」、「4-278」および「4-25」を施用してから1週間後に、除草剤の施用による症状を評価すると、トランスジェニック植物は野生型ダイズ植物と比較して優れた耐性を示す。 40

【0209】

H-耐性HPPD酵素FMP27およびFMP37を発現するワタ植物のHPPD阻害薬に対する耐性の評価

選択されたHPPDをコードする遺伝子を、ブレファリスマ・ジャポニクム (*Blepharisma japonicum*) およびコルディア・アルギシダ (*Kordia algicida*) からなる生物の群の1員から得て、CaMV35Sプロモーターの制御下にワタゲノムへのDNAの組み込みを可能とする適切なバイナリーベクターにクローニングした。その個々のクローニング手順については、ブレファリスマ・ジャポニクム (50

Blepharisma japonicum) (FMP37) についてはWO2011076882 (PCT/EP2010/070567) 実施例11を、そしてコルディア・アルギシダ (*Kordia algicida*) (FMP27) についてはWO2011076889 (PCT/EP2010/070575) 実施例11を参照する。

【0210】

プロモーターに相当する配列とHPPDをコードする配列の間で、葉緑体への輸送ペプチドをコードするDNA配列を挿入して、タンパク質のN末端先端で標的シグナルを負荷して、植物葉緑体へのHPPDタンパク質の局在化を可能とした。ブレファリスマ・ジャポニクム (*Blepharisma japonicum*) (FMP37) についてはWO2011076882 (PCT/EP2010/070567) の実施例12およびコルディア・アルギシダ (*Kordia algicida*) (FMP27) についてはWO2011076889 (PCT/EP2010/070575) に記載の方法に従って、ワタの形質転換を行った。テンボトリオンに対する耐性を示すT0イベントからの種子を収穫した。
10

【0211】

T1ワタ種子を単一ポットに移し、標準的な条件下で成長させた (ブレファリスマ・ジャポニクム (*Blepharisma japonicum*) (FMP37) についてはWO2011076882 (PCT/EP2010/070567) およびコルディア・アルギシダ (*Kordia algicida*) (FMP27) についてはWO2011076889 (PCT/EP2010/070575) を参照する)。
20

【0212】

少なくとも4週間後、植物に上記で定義のいくつかのN- (テトラゾール-4-イル)-もしくはN- (トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類を噴霧する。例えば、化合物「5-148」、「4-137」、「4-253」、「4-278」および「4-25」を施用してから1週間に後に、除草剤の施用による症状を評価すると、トランジェニック植物は野生型ワタ植物と比較して優れた耐性を示す。

【配列表】

0005847921000001.app

フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I
A 01 N 43/40 (2006.01)	A 01 N 43/40 101B
A 01 N 43/56 (2006.01)	A 01 N 43/56 Z N A C

(74)代理人 100124855
弁理士 坪倉 道明

(74)代理人 100129713
弁理士 重森 一輝

(74)代理人 100137213
弁理士 安藤 健司

(74)代理人 230105223
弁護士 城山 康文

(72)発明者 ポリー, フアビアン
ドイツ国、65936・フランクフルト、ドゥナントリング・89

(72)発明者 フアン・アルムシツク, アンドレアス
ドイツ国、61184・カーベン、アム・プロイル・4ペー

(72)発明者 ブラウン, ラルフ
ドイツ国、76857・ラムベルク、ビショフ - ベック - シュトラーセ・1アーテ・12

(72)発明者 ラバー, ベルント
ドイツ国、65510・イトシユタイン、グラーフ - フォン - シュタウフェンベルク - シュトラーセ・12

(72)発明者 ハイン, リュディガー
ドイツ国、60594・フランクフルト、ドライアイヒシュトラーセ・44

審査官 水島 英一郎

(56)参考文献 特開昭57-081467(JP, A)
欧州特許出願公開第00049071(EP, A1)
特表平11-505729(JP, A)
米国特許第06268549(US, B1)
国際公開第2006/132270(WO, A1)
特表2008-533081(JP, A)
特表2013-536817(JP, A)
米国特許出願公開第2012/0058892(US, A1)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

A 01 N	43 / 653
A 01 N	43 / 713
A 01 P	13 / 00
A 01 H	5 / 00
C 12 N	15 / 00

(54)【発明の名称】H P P D阻害薬型除草剤に対して耐性であるトランスジェニック作物の区域で望ましくない植物を防除するためのN-(テトラゾール-4-イル)-もしくはN-(トリアゾール-3-イル)アリールカルボキサミド類またはそれらの塩の使用