(19)日本国特許庁(JP)　(12)公表特許公報(A)　(11)公表番号
特表2025-519205
(P2025-519205A)
(43)公表日　令和7年6月24日(2025.6.24)

(51)国際特許分類			FI			テーマコード（参考）
C07D	*401/04*	*(2006.01)*	C07D	401/04		CSP　4H011
A01P	*13/00*	*(2006.01)*	A01P	13/00		
A01N	*43/56*	*(2006.01)*	A01N	43/56	D	

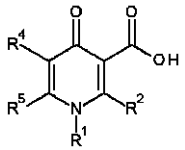
審査請求　未請求　予備審査請求　未請求　（全50頁）

(21)出願番号　特願2024-570725(P2024-570725)
(86)(22)出願日　令和5年5月26日(2023.5.26)
(85)翻訳文提出日　令和6年11月29日(2024.11.29)
(86)国際出願番号　PCT/EP2023/064172
(87)国際公開番号　WO2023/232673
(87)国際公開日　令和5年12月7日(2023.12.7)
(31)優先権主張番号　22176865.8
(32)優先日　令和4年6月1日(2022.6.1)
(33)優先権主張国・地域又は機関
欧州特許庁(EP)
(81)指定国・地域　AP(BW,CV,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV
最終頁に続く

(71)出願人　520222106
シンジェンタ クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト
スイス ４０５８ バーゼル ローゼンタールシュトラーセ ６７
(74)代理人　100103610
弁理士　▲吉▼田 和彦
(74)代理人　100109070
弁理士　須田 洋之
(74)代理人　100119013
弁理士　山崎 一夫
(74)代理人　100111796
弁理士　服部 博信
(74)代理人　100123766
弁理士　松田 七重
最終頁に続く

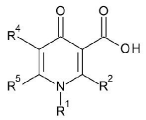
(54)【発明の名称】　除草剤誘導体

(57)【要約】
置換基は請求項１に定義されているとおりである、式（Ｉ）の化合物。本発明はさらに、式（Ｉ）の化合物を含む除草組成物、及び、特に有用な植物の作物における、雑草を防除するための式（Ｉ）の化合物の使用に関する。



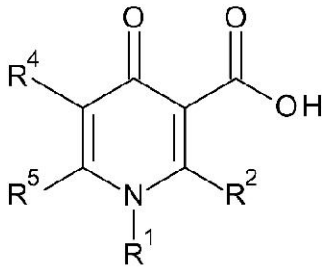
(I)

【化１】



(I)

【特許請求の範囲】
【請求項１】
式（Ｉ）：
【化１】



(I)

（式中、
Ｒ[1]は、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシ、Ｃ[2]～Ｃ[6]アルケニル、Ｃ[2]～Ｃ[6]アルキニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシＣ[1]～Ｃ[6]アルキル、又はＣ[3]～Ｃ[6]シクロアルキルであり；
Ｒ[2]は、フェニル又はヘテロアリールであり、前記ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２、３若しくは４個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員芳香族環であり、並びに、各フェニル及びヘテロアリール部分は、Ｒ[7]により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、３、若しくは４個の基で任意に置換されていてもよく；
Ｒ[4]はヘテロアリールであり、前記ヘテロアリール部分は、１、２、若しくは３個の窒素原子を含む５員芳香族単環式環であり、前記ヘテロアリール部分は、前記ヘテロアリール環中の窒素原子を介して分子の残部に結合しており、前記ヘテロアリール部分は、各々、Ｒ[9]により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、３、若しくは４個の基で任意に置換されていてもよく；
Ｒ[5]は、水素、ハロゲン、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキル、Ｃ[1]～Ｃ[6]ハロアルキル、又はＣ[3]～Ｃ[6]シクロアルキルであり；
Ｒ[7]は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシ、Ｃ[1]～Ｃ[6]ハロアルキル、Ｃ[1]～Ｃ[6]ハロアルコキシ、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシＣ[1]～Ｃ[6]アルキル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルスルファニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルスルフィニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルスルホニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルスルホンアミド、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルカルボニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシカルボニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルアミノカルボニル、Ｃ[3]～Ｃ[6]シクロアルキル、Ｃ[3]～Ｃ[6]シクロアルキルアミノカルボニル、又はＮ，Ｎ－ジ（Ｃ[1]～Ｃ[4]アルキル）アミノカルボニルであり；
Ｒ[9]は、ホルミル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、ハロゲン、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシ、Ｃ[1]～Ｃ[6]ハロアルキル、Ｃ[1]～Ｃ[6]ハロアルコキシ、Ｃ[2]～Ｃ[6]アルケニルオキシ、シアノＣ[1]～Ｃ[6]アルコキシ、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシＣ[1]～Ｃ[6]アルキル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシＣ[1]～Ｃ[6]アルコキシ、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシカルボニルＣ[1]～Ｃ[6]アルコキシ、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシカルボニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルスルファニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルスルフィニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルスルホニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルスルホンアミド、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルカルボニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルアミノカルボニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルカルボニルアミノ、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルキルアミノ、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシＣ[1]～Ｃ[6]アルキルアミノカルボニル、Ｃ[1]～Ｃ[6]アルコキシＣ[1]～Ｃ[6]アルキルカルボニルアミノ、Ｃ[2]～Ｃ[6]アルケニルカルボニルアミノ、Ｃ[3]～Ｃ[6]シクロアルキル、Ｃ[3]～Ｃ[6]シクロアルキルアミノカルボニル、Ｎ，Ｎ－ジ（Ｃ[1]～Ｃ[4]アルキル）アミノ、Ｎ，Ｎ－ジ（Ｃ[1]～Ｃ[4]アルキル）アミノカルボニル、若しくはベンジルオキシであり；
いずれかの隣接する２つのＲ[9]基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、Ｃ[3]

～C_6シクロアルキル環又はフェニル環を形成し得、前記C_3～C_6シクロアルキル及びフェニル部分は、R^{10}により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、３若しくは４個の基で任意に置換されていてもよく；又は
いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロアリール環を形成し得、前記ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２、３若しくは４個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員芳香族環であり、前記ヘテロアリール部分は、R^{10}により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、３、若しくは４個の基で任意に置換されていてもよく；又は
いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロシクリル環を形成し得、前記ヘテロシクリル部分は、Ｏ及びＮから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員であり、前記ヘテロシクリル環は、R^{10}により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、３若しくは４個の基で任意に置換されていてもよく；
R^{10}は、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、又はC_1～C_3アルコキシである）
の化合物；又は、その塩若しくはＮ－オキシド。
【請求項２】
R^2はフェニル又はヘテロアリールであり、前記ヘテロアリール部分は、Ｎ及びＯから個々に選択される１又は２個のヘテロ原子を含む５又は６員芳香族環であり、並びに、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^7により表される同一であっても異なっていてもよい１、２又は３個の基で任意に置換されていてもよい、請求項１に記載の化合物。
【請求項３】
R^2は、R^7により表される同一であっても異なっていてもよい１又は２個の基で任意に置換されていてもよいフェニルである、請求項１又は請求項２に記載の化合物。
【請求項４】
R^5は水素又はC_1～C_3アルキルである、請求項１～３のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項５】
R^7は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_1～C_3ハロアルキル、C_1～C_3ハロアルコキシ、C_1～C_3アルコキシC_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルキルカルボニル、又はC_3～C_6シクロアルキルである、請求項１～４のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項６】
R^4はヘテロアリールであり、前記ヘテロアリール部分は、１、２又は３個の窒素原子を含む５員芳香族単環式環であり、及び、前記ヘテロアリール部分は、前記ヘテロアリール環中の窒素原子を介して分子の残部に結合しており、及び、前記ヘテロアリール部分は各々、R^9により表される同一であっても異なっていてもよい１、２又は３個の基で任意に置換されていてもよい、請求項１～５のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項７】
R^4はヘテロアリールであり、前記ヘテロアリール部分は、２又は３個の窒素原子を含む５員芳香族単環式環であり、前記ヘテロアリール部分は、前記ヘテロアリール環中の窒素原子を介して分子の残部に結合しており、前記ヘテロアリール部分は各々、R^9により表される同一であっても異なっていてもよい１、２又は３個の基で任意に置換されていてもよい、請求項１～６のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項８】
R^9は、ホルミル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、ハロゲン、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_2～C_6アルケニルオキシ、シアノC_1～C_4アルコキシ、C_1～C_4アルコキシC_1～C_4アルキル、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルコキシ、C_1～C_4アルコキシカルボニルC_1～C_4アルコキシ、C_1～C_6アルコキシカルボニル、C_1～C_4アルキルスルファニル、C_1～C_4アルキルスルフィニル、C_1～C_4アルキルスルホニル、C_1～C_4アルキルスルホンアミド、

C_1～C_6アルキルカルボニル、C_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_1～C_6アルキルカルボニルアミノ、C_1～C_6アルキルアミノ、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_1～C_4アルコキシC_1～C_4アルキルカルボニルアミノ、C_2～C_6アルケニルカルボニルアミノ、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル、Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_3アルキル）アミノ、Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_3アルキル）アミノカルボニル、若しくはベンジルオキシであり；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、C_3～C_6シクロアルキル環又はフェニル環を形成し得、前記C_3～C_6シクロアルキル及びフェニル部分は、R^{10}により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、若しくは３個の基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロアリール環を形成し得、前記ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２、若しくは３個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員芳香族環であり、前記ヘテロアリール部分は、R^{10}により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、若しくは３個の基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロシクリル環を形成し得、前記ヘテロシクリル部分は、Ｏ及びＮから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員であり、前記ヘテロシクリル環は、R^{10}により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、若しくは３個の基で任意に置換されていてもよい、

請求項１～７のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項９】

R^9は、ホルミル、シアノ、ニトロ、ハロゲン、C_1～C_4アルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_1～C_3ハロアルキル、C_1～C_2ハロアルコキシ、C_2～C_3アルケニルオキシ、シアノC_1～C_2アルコキシ、C_1～C_3アルコキシC_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシC_1～C_3アルコキシ、C_1～C_3アルコキシカルボニルC_1～C_3アルコキシ、C_1～C_3アルコキシカルボニル、C_1～C_3アルキルスルファニル、C_1～C_3アルキルスルホニル、C_1～C_3アルキルカルボニル、C_1～C_3アルキルアミノカルボニル、C_1～C_3アルキルカルボニルアミノ、C_1～C_3アルキルアミノ、C_1～C_3アルコキシC_1～C_3アルキルアミノカルボニル、C_1～C_2アルコキシC_1～C_2アルキルカルボニルアミノ、C_3～C_4アルケニルカルボニルアミノ、C_3～C_4シクロアルキル、若しくはＮ，Ｎ－ジ（C_1～C_3アルキル）アミノであり；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、C_5～C_6シクロアルキル環又はフェニル環を形成し得、前記C_5～C_6シクロアルキル及びフェニル部分は、ただ一つのR^{10}で任意に置換されていてもよく；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、６員ヘテロアリール環を形成し得、前記ヘテロアリール部分は、ただ一つの窒素原子を含む６員芳香族環であり、前記ヘテロアリール部分は、ただ一つのR^{10}基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロシクリル環を形成し得、前記ヘテロシクリル部分は、Ｏ及びＮから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員であり、前記ヘテロシクリル環は、ただ一つのR^{10}基で任意に置換されていてもよい、

請求項１～７のいずれか一項に記載の化合物。

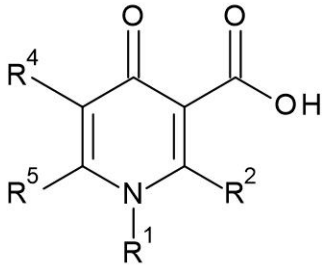
【請求項１０】

R^{10}はハロゲン又はC_1～C_3アルコキシである、請求項１～９のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１１】

請求項１～１０のいずれか一項に記載の化合物及び農学的に許容可能な配合補助剤を含む除草組成物。

【請求項１２】
少なくとも１種の追加の殺有害生物剤をさらに含む、請求項１１に記載の除草組成物。
【請求項１３】
前記追加の殺有害生物剤は、除草剤又は除草剤毒性緩和剤である、請求項１２に記載の除草組成物。
【請求項１４】
不要な植物の成長を防除する方法であって、請求項１～１０のいずれか一項に記載の式（Ｉ）の化合物、又は、請求項１１～１３のいずれか一項に記載の除草組成物を、前記不要な植物若しくはその生息地に適用するステップを含む方法。
【請求項１５】
除草剤としての、請求項１～１０のいずれか一項に記載の式（Ｉ）の化合物の使用。
【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
本発明は、例えば除草性活性を有する有効成分としての除草性ピリドン誘導体に関する。本発明はまた、少なくとも１種のピリドン誘導体を含む農薬組成物、これら化合物の調製プロセス、及び、特に有用な植物の作物における、農業又は園芸における雑草の防除におけるピリドン誘導体又は組成物の使用に関する。
【背景技術】
【０００２】
欧州特許第０２３９３９１号明細書、欧州特許第０１２７３１３号明細書、欧州特許第００４００８２号明細書、及び英国特許第２１８２９３１号明細書には、除草剤としてのピリドン誘導体が記載されている。
【発明の概要】
【課題を解決するための手段】
【０００３】
本発明によれば、式（１）：
【化１】



(I)

（式中、
R^1は、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキル、又はC_3～C_6シクロアルキルであり；
R^2は、フェニル又はヘテロアリールであり、ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２、３若しくは４個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員芳香族環であり、並びに、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^7により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、３、若しくは４個の基で任意に置換されていてもよく；
R^4はヘテロアリールであり、ヘテロアリール部分は、１、２、若しくは３個の窒素原子を含む５員芳香族単環式環であり、ヘテロアリール部分は、ヘテロアリール環中の窒素原子を介して分子の残部に結合しており、ヘテロアリール部分は、各々、R^9により表さ

れる、同一であっても異なっていてもよい、１、２、３、若しくは４個の基で任意に置換されていてもよく；

R^5は、水素、ハロゲン、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、又はC_3～C_6シクロアルキルであり；

R^7は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルキルスルファニル、C_1～C_6アルキルスルフィニル、C_1～C_6アルキルスルホニル、C_1～C_6アルキルスルホンアミド、C_1～C_6アルキルカルボニル、C_1～C_6アルコキシカルボニル、C_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル、又はＮ，Ｎ－ジ（C_1～C_4アルキル）アミノカルボニルであり；

R^9は、ホルミル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、ハロゲン、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_2～C_6アルケニルオキシ、シアノC_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6アルコキシカルボニルC_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6アルコキシカルボニル、C_1～C_6アルキルスルファニル、C_1～C_6アルキルスルフィニル、C_1～C_6アルキルスルホニル、C_1～C_6アルキルスルホンアミド、C_1～C_6アルキルカルボニル、C_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_1～C_6アルキルカルボニルアミノ、C_1～C_6アルキルアミノ、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキルカルボニルアミノ、C_2～C_6アルケニルカルボニルアミノ、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル、Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_4アルキル）アミノ、Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_4アルキル）アミノカルボニル、若しくはベンジルオキシであり；

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、C_3～C_6シクロアルキル環又はフェニル環を形成し得、C_3～C_6シクロアルキル及びフェニル部分は、R^{10}により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、３若しくは４個の基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロアリール環を形成し得、ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２、３若しくは４個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員芳香族環であり、ヘテロアリール部分は、R^{10}により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、３、若しくは４個の基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロシクリル環を形成し得、ヘテロシクリル部分は、Ｏ及びＮから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員であり、ヘテロシクリル環は、R^{10}により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、３若しくは４個の基で任意に置換されていてもよく；

R^{10}は、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、又はC_1～C_3アルコキシである）

の化合物；又は、その塩若しくはＮ－オキシドが提供される。

【０００４】

意外なことに、式（Ｉ）の新規化合物は、実用的な目的について、きわめて有利なレベルの除草性活性を有することが見出された。

【０００５】

本発明の第２の態様によれば、除草性有効量の本発明に係る式（Ｉ）の化合物を含む農薬組成物が提供される。このような農業組成物は、少なくとも１種の追加の有効成分及び／又は農芸化学的に許容可能な希釈剤若しくはキャリアをさらに含んでいてもよい。

【０００６】

本発明の第３の態様によれば、生息地において雑草を防除する方法であって、生息地に、雑草防除量の式（Ｉ）の化合物を含む組成物を適用するステップを含む方法が提供される。

【０００７】
本発明の第４の態様によれば、除草剤としての式（Ｉ）の化合物の使用が提供される。
【発明を実施するための形態】
【０００８】
置換基が「任意に置換されていてもよい」と記載されている場合、これは、１個以上の同等又は異なる置換基、例えば、１個、２個又は３個のR^9置換基を有していても有していなくてもよいことを意味する。例えば、１、２又は３個のハロゲンにより置換されているC_1～C_6アルキルとしては、特に限定されないが、－CH_2Cl、－$CHCl_2$、－CCl_3、－CH_2F、－CHF_2、－CF_3、－CH_2CF_3又は－CF_2CH_3基が挙げられ得る。他の例として、１、２又は３個のハロゲンにより置換されているC_1～C_6アルコキシとしては、特にこれらに限定されないが、CH_2ClO－、$CHCl_2O$－、CCl_3O－、CH_2FO－、CHF_2O－、CF_3O－、CF_3CH_2O－又はCH_3CF_2O－基が挙げられ得る。
【０００９】
本明細書において用いられるところ、「シアノ」という用語は、－ＣＮ基を意味する。
【００１０】
本明細書において用いられるところ、「ヒドロキシ」又は「ヒドロキシル」という用語は、－ＯＨ基を指す。
【００１１】
本明細書において用いられるところ、「ハロゲン」という用語は、フッ素（フルオロ）、塩素（クロロ）、臭素（ブロモ）又はヨウ素（ヨード）を指す。
【００１２】
本明細書において用いられるところ、「ニトロ」という用語は、－NO_2基を意味する。
【００１３】
本明細書において用いられるところ、「ホルミル」という用語は、－Ｃ（Ｏ）Ｈ基を意味する。
【００１４】
本明細書において用いられるところ、「アセチル」という用語は、－Ｃ（Ｏ）CH_3基を意味する。
【００１５】
本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルキル」という用語は、炭素及び水素原子のみから構成され、不飽和を含まず、１～６個の炭素原子を有し、並びに、単結合によって分子の残部に結合している直鎖又は分岐鎖炭化水素鎖基を指す。「C_1～C_4アルキル」及び「C_1～C_3アルキル」も同様に解釈されるべきである。C_1～C_6アルキルの例としては、これらに限定されないが、メチル、エチル、ｎ－プロピル、及び、その異性体、例えば、イソプロピルが挙げられる。「C_1～C_6アルキレン」基はC_1～C_6アルキルの対応する定義を指すが、ただし、このような基は、２つの単結合によって分子の残部に結合していることを除く。「C_1～C_2アルキレン」という用語も同様に解釈されるべきである。C_1～C_6アルキレンの例としては、これらに限定されないが、－CH_2－、－CH_2CH_2－及び－（CH_2）$_3$－が挙げられる。
【００１６】
本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6ハロアルキル」という用語は、１つ以上の同一又は異なるハロゲン原子により置換されている、一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキル基を指す。「C_1～C_4ハロアルキル」及び「C_1～C_3ハロアルキル」という用語も同様に解釈されるべきである。C_1～C_6ハロアルキルの例としては、これらに限定されないが、トリフルオロメチルが挙げられる。
【００１７】
本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルコキシ」という用語は、R_aが一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキル基である式－OR_aの基を指す。「C_1～

C_4アルコキシ」及び「C_1～C_3アルコキシ」という用語も同様に解釈されるべきである。C_1～C_6アルコキシの例としては、これらに限定されないが、メトキシ、エトキシ、１－メチルエトキシ（イソプロポキシ）及びプロポキシが挙げられる。

【００１８】

本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6ハロアルコキシ」という用語は、１つ以上の同一又は異なるハロゲン原子により置換されている、一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルコキシ基を指す。「C_1～C_4ハロアルコキシ」及び「C_1～C_3ハロアルコキシ」という用語も同様に解釈されるべきである。C_1～C_6ハロアルコキシの例としては、これらに限定されないが、トリフルオロメトキシが挙げられる。

【００１９】

本明細書において用いられるところ、「シアノC_1～C_6アルコキシ」という用語は、一般に上記に定義されているとおり、１個以上のシアノ基で置換されたC_1～C_6アルコキシ基を指す。「シアノC_1～C_4アルコキシ」及び「シアノC_1～C_3アルコキシ」という用語も同様に解釈されるべきである。シアノC_1～C_6アルコキシの例としては、これらに限定されないが、シアノエトキシが挙げられる。

【００２０】

本明細書において用いられるところ、「C_2～C_6アルケニル」という用語は、炭素及び水素原子のみから構成され、（Ｅ）－又は（Ｚ）－立体配置であることが可能である少なくとも１つの二重結合を含み、単結合によって分子の残部に結合している２～６個の炭素原子を有する直鎖又は分岐鎖炭化水素鎖基を指す。「C_2～C_3アルケニル」という用語も同様に解釈されるべきである。C_2～C_6アルケニルの例としては、これらに限定されないが、エテニル（ビニル）、プロプ－１－エニル、プロプ－２－エニル（アリル）、ブタ－１－エニルが挙げられる。

【００２１】

本明細書において用いられるところ、「C_2～C_6アルキニル」という用語は、炭素及び水素原子のみから構成され、少なくとも１つの三重結合を含有し、２～６個の炭素原子を有し、並びに、単結合によって分子の残部に結合している直鎖又は分岐鎖炭化水素鎖基を指す。「C_2～C_3アルキニル」という用語も同様に解釈されるべきである。C_2～C_6アルキニルの例としては、これらに限定されないが、エチニル、プロプ－１－イニル、ブタ－１－イニルが挙げられる。

【００２２】

本明細書において用いられるところ、「C_2～C_6アルケニルオキシ」という用語は、炭素及び水素原子のみから構成され、（Ｅ）－又は（Ｚ）－立体配置であることが可能である少なくとも１つの二重結合を含み、酸素リンカーで分子の残部に結合している２～６個の炭素原子を有する直鎖又は分岐鎖炭化水素鎖ラジカル基を指す。

【００２３】

本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキル」という用語は、R_bが一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキル基であり、及び、R_aが一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキレン基である式R_bOR_a－の基を指す。「C_1～C_4アルコキシC_1～C_4アルキル」という用語も同様に解釈されるべきである。

【００２４】

本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルコキシ」という用語は、R_a及びR_bが両方とも、一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキレン基である式R_bOR_aO－の基を指す。「C_1～C_4アルコキシC_1～C_4アルコキシ」という用語は同様に解釈されるべきである。

【００２５】

本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルコキシカルボニルC_1～C_6アルコキシ」という用語は、R_a及びR_bが共に一般に上記に定義されているC_1～C_6アルキレン基である、式$R_bOC(O)R_aO$－の基を指す。

【００２６】
本明細書において用いられるところ、「C_3～C_6シクロアルキル」という用語は、単環式飽和環系であり、及び、３～６個の炭素原子を含有する基を指す。「C_3～C_5シクロアルキル」及び「C_3～C_4シクロアルキル」という用語も同様に解釈されるべきである。C_3～C_6シクロアルキルの例としては、これらに限定されないが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシルが挙げられる。
【００２７】
本明細書において用いられるところ、「C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル」という用語は、－ＮＨＣ（Ｏ）－リンカーを介して分子の残部に結合しているC_3～C_6シクロアルキル環を指す。
【００２８】
本明細書において用いられるところ、「ベンジルオキシ」という用語は、酸素原子を介して分子の残部に結合しているベンジル環を指す。
【００２９】
別途記載がない限り、本明細書において用いられるところ、「ヘテロアリール」という用語は、窒素、酸素及び硫黄から個々に選択される１、２、３又は４個のヘテロ原子を含む５又は６員芳香族単環式環基を指す。いくつかの事例においては、ヘテロアリール部分は、ヘテロアリール環中の窒素原子で分子の残部に結合していてもよい。他の場合、ヘテロアリール部分は、ヘテロアリール環中の炭素原子で分子の残部に結合していてもよい。ヘテロアリールの例としては、これらに限定されないが、フラニル、ピロリル、チエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ピラジニル、ピリダジニル、ピリミジル又はピリジルが挙げられる。
【００３０】
本明細書において用いられるところ、「ヘテロシクリル」という用語は、１、２又は３個のヘテロ原子を含む安定な４、５又は６員非芳香族単環式環を指し、ここで、ヘテロ原子は、窒素、酸素及び硫黄から個々に選択される。ヘテロシクリル基は、炭素原子又はヘテロ原子を介して分子の残部に結合し得る。ヘテロシクリルの例としては、これらに限定されないが、アジリジニル、アゼチジニル、オキセタニル、チエタニル、テトラヒドロフリル、ピロリジニル、ピラゾリジニル、イミダゾリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、ジオキソラニル、ジチオラニル及びチアゾリジニルが挙げられる。
【００３１】
本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルキルカルボニル」という用語は、R_aが一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキル基である式－Ｃ（Ｏ）R_aの基を指す。C_1～C_6アルキルカルボニルの例としては、これらに限定されないが、アセチルが挙げられる。
【００３２】
本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルコキシカルボニル」という用語は、R_aが一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキル基である式－Ｃ（Ｏ）ＯR_aの基を指す。
【００３３】
本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルキルアミノ」という用語は、一般に上記に定義されているとおり、R_aがC_1～C_6アルキル基である式R_aＮＨ－の基を指す。
【００３４】
本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルキルアミノカルボニル」という用語は、R_aが一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキル基である式－Ｃ（Ｏ）ＮＨR_aの基を指す。
【００３５】
本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルキルカルボニルアミノ」という

用語は、一般に上記に定義されているとおり、R_aがC_1～C_6アルキル基である式R_aC（Ｏ）ＮＨ－の基を指す。

【００３６】

本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキルアミノカルボニル」という用語は、一般に上記に定義されているとおり、R_aがC_1～C_6アルキル基であり、R_aがC_1～C_6アルキレン基である式R_aOR_bNHC（Ｏ）－の基を指す。

【００３７】

本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキルカルボニルアミノ」という用語は、一般に上記に定義されているとおり、R_aがC_1～C_6アルキル基であり、R_aがC_1～C_6アルキレン基である式R_aOR_bC（Ｏ）ＮＨ－の基を指す。

【００３８】

本明細書において用いられるところ、「C_2～C_6アルケニルカルボニルアミノ」という用語は、一般に上記に定義されているとおり、R_aがC_1～C_6アルキレン基である式R_aOC（Ｏ）ＮＨ－の基を指す。

【００３９】

本明細書において用いられるところ、「Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_4アルキル）アミノ」という用語は、一般に上記に定義されているとおり、各R_a及びR_bが個々にC_1～C_4アルキル基である式（R_a）（R_b）ＮＨ－の基を指す。

【００４０】

本明細書において用いられるところ、「Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_4アルキル）アミノカルボニル」という用語は、R_a及びR_bが各々、個々に一般的に上記に定義されているC_1～C_4アルキル基である式－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R_a）（R_b）の基を指す。「Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_3アルキル）アミノカルボニル」という用語も同様に解釈されるべきである。

【００４１】

本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルキルスルファニル」という用語は、R_aが一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキル基である式－ＳR_aの基を指す。「C_1～C_4アルキルスルファニル」及び「C_1～C_3アルキルスルファニル」という用語も同様に解釈されるべきである。C_1～C_6アルキルスルファニルの例としては、これらに限定されないが、メチルスルファニルが挙げられる。

【００４２】

本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルキルスルフィニル」という用語は、R_aが一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキル基である式－Ｓ（Ｏ）R_aの基を指す。「C_1～C_4アルキルスルフィニル」及び「C_1～C_3アルキルスルフィニル」という用語も同様に解釈されるべきである。C_1～C_6アルキルスルフィニルの例としては、これらに限定されないが、メチルスルフィニルが挙げられる。

【００４３】

本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルキルスルホニル」という用語は、R_aが一般的に上記に定義されているC_1～C_6アルキル基である式－Ｓ（Ｏ）$_2$$R_a$の基を指す。「$C_1$～$C_4$アルキルスルホニル」及び「$C_1$～$C_3$アルキルスルホニル」という用語も同様に解釈されるべきである。C_1～C_6アルキルソルファニル（ａｌｋｙｌｓｏｌｆａｎｙｌ）の例としては、これらに限定されないが、メチルスルホニルが挙げられる。

【００４４】

本明細書において用いられるところ、「C_1～C_6アルキルスルホンアミド」という用語は、式－ＮＨＳ（Ｏ）$_2$$R_a$の基を指し、$R_a$は一般的に上記に定義されている$C_1$～$C_6$アルキル基である。

【００４５】

１つ以上の可能なステレオジエン要素が式（Ｉ）の化合物に存在するとは、その化合物が光学異性形態、すなわち、鏡像異性形態又はジアステレオ異性形態をとり得ることを意味する。また、アトロプ異性体は、単結合に係る回転の制限によって生じ得る。式（Ｉ）

は、すべてのこれらの可能性のある異性形態及びその混合物を含むことが意図されている。本発明は、式（Ｉ）の化合物に係るすべてのこれらの可能性のある異性形態及びその混合物を含む。同様に、式（Ｉ）は、すべての可能性のある互変異性体を含むことが意図されている。本発明は、式（Ｉ）の化合物に係るすべての可能性のある互変異性形態を含む。

【００４６】

各事例において、本発明に係る式（Ｉ）の化合物は、遊離形態、Ｎ－オキシドとして酸化型、又は、塩形態、例えば農学的に使用可能な塩形態である。式（Ｉ）の化合物が、第一級、第二級及び第三級アミン（例えばアンモニア、ジメチルアミン及びトリエチルアミン）を含むアミン、アルカリ金属及びアルカリ土類金属塩基、遷移金属又は第四級アンモニウム塩基と形成し得る塩が好ましい。

【００４７】

Ｎ－オキシドは、第三級アミンの酸化型又は窒素含有芳香族複素環式化合物の酸化型である。これらは、例えば、Ａ．Ａｌｂｉｎｉ ａｎｄ Ｓ．Ｐｉｅｔｒａによる書籍“Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌｉｃ Ｎ－ｏｘｉｄｅｓ”，ＣＲＣ Ｐｒｅｓｓ，Ｂｏｃａ Ｒａｔｏｎ（１９９１）に記載されている。

【００４８】

以下のリストは、式（Ｉ）の化合物を参照して、置換基R^1、R^2、R^4、R^5、R^6、R^7、R^9、R^{10}に係る定義（好ましい定義を含む）を提供する。これらの置換基のいずれか１つについて、以下に記載の定義のいずれかは、本書面中以下又は他の箇所に記載されている、いずれかの他の置換基のいずれかの定義と組み合わされ得る。

【００４９】

R^1はC_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_2～C_6アルケニル、C_2～C_6アルキニル、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキル、又はC_3～C_6シクロアルキルである。好ましくは、R^1はC_1～C_4アルキル、C_1～C_4アルコキシ、C_2～C_4アルケニル、C_2～C_4アルキニル、C_1～C_4アルコキシC_1～C_4アルキル、又はC_3～C_6シクロアルキルである。より好ましくは、R^1はC_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_2～C_3アルケニル、C_2～C_3アルキニル、C_1～C_3アルコキシC_1～C_3アルキル、又はC_3～C_4シクロアルキルである。さらにより好ましくは、R^1は、メチル、エチル、ｎ－プロピル、メトキシ、２－メトキシエチル、アリー、及びプロプ－２－イニルである。さらにより好ましくは、R^1はメチル又はエチルである。一連の実施形態において、R^1はエチルである。

【００５０】

R^2はフェニル又はヘテロアリールであり、ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２、３又は４個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員芳香族環であり、並びに、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^7により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３又は４個の基で任意に置換されていてもよい。

【００５１】

好ましくは、R^2はフェニル又はヘテロアリール（ここで、ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２又は３個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員芳香族環である）であり、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^7により表される同一であっても異なっていてもよい１、２又は３個の基で任意に置換されていてもよい。

【００５２】

より好ましくは、R^2はフェニル又はヘテロアリール（ここで、ヘテロアリール部分は、Ｎ及びＯから個々に選択される１又は２個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員芳香族環である）であり、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^7により表される同一であっても異なっていてもよい１、２又は３個の基で任意に置換されていてもよい。

【００５３】

さらにより好ましくは、R^2はフェニル又はヘテロアリール（ここで、ヘテロアリール部分は、Ｎ及びＯから個々に選択される１又は２個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員

芳香族環である）であり、各フェニル及びヘテロアリール部分は、R^7により表される同一であっても異なっていてもよい１又は２個の基で任意に置換されていてもよい。

【００５４】

さらにより好ましくは、R^2は、R^7により表される、同一であっても異なっていてもよい、１若しくは２個の基で任意に置換されていてもよいフェニルである。一組の実施形態において、R^2は、３，４－ジクロロフェニル又は３，４－ジフルオロフェニル、好ましくは３，４－ジクロロフェニルである。

【００５５】

R^4はヘテロアリールであり、ヘテロアリール部分は、１、２又は３個の窒素原子を含む５員芳香族単環式環であり、及び、ヘテロアリール部分は、ヘテロアリール環中の窒素原子を介して分子の残部に結合しており、及び、ヘテロアリール部分は各々、R^9により表される同一であっても異なっていてもよい１、２、３又は４個の基で任意に置換されていてもよい。

【００５６】

好ましくは、R^4はヘテロアリールであり、ヘテロアリール部分は、１、２又は３個の窒素原子を含む５員芳香族単環式環であり、及び、ヘテロアリール部分は、ヘテロアリール環中の窒素原子を介して分子の残部に結合しており、及び、ヘテロアリール部分は各々、R^9により表される同一であっても異なっていてもよい１、２又は３個の基で任意に置換されていてもよい。

【００５７】

より好ましくは、R^4はヘテロアリールであり、ヘテロアリール部分は、２又は３個の窒素原子を含む５員芳香族単環式環であり、及び、ヘテロアリール部分は、ヘテロアリール環中の窒素原子を介して分子の残部に結合しており、及び、ヘテロアリール部分は各々、R^9により表される同一であっても異なっていてもよい１、２又は３個の基で任意に置換されていてもよい。

【００５８】

さらにより好ましくは、R^4は、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリルであり、ここで、ピラゾリル、イミダゾリル及びトリアゾリル部分のいずれかは、各々、R^9により表される同一であっても異なっていてもよい１、２又は３個の基で任意に置換されていてもよい。

【００５９】

一組の実施形態において、R^4は、ヘテロアリールであり、ヘテロアリール部分は、２個の窒素原子を含む５員芳香族単環式環であり、ヘテロアリール部分は、ヘテロアリール環中の窒素原子を介して分子の残部に結合しており、ヘテロアリール環は、R^9により表される３個の基で任意に置換されていてもよく、１つのR^9基は、ホルミル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、ハロゲン、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_2～C_6アルケニルオキシ、シアノC_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6アルコキシカルボニルC_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6アルコキシカルボニル、C_1～C_6アルキルスルファニル、C_1～C_6アルキルスルフィニル、C_1～C_6アルキルスルホニル、C_1～C_6アルキルスルホンアミド、C_1～C_6アルキルカルボニル、C_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_1～C_6アルキルカルボニルアミノ、C_1～C_6アルキルアミノ、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキルカルボニルアミノ、C_2～C_6アルケニルカルボニルアミノ、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル、Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_4アルキル）アミノ、Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_4アルキル）アミノカルボニル、又はベンジルオキシから選択され、いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、フェニル環を形成し得、結果として生じるフェニル部分は、ただ一つのR^{10}基で任意に置換されていてもよい。

【００６０】

別の組の実施形態において、R^4は、ピラゾリル、トリアゾリル、又はインダゾリルであり、各部分は、シアノ、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3ハロアルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_1～C_3ハロアルコキシ、C_1～C_2アルコキシC_1～C_2アルキル、C_1～C_2アルキルカルボニル、及びC_3～C_4シクロアルキルから選択される１若しくは２個の置換基により任意に置換されていてもよい。好ましくは、R^4は、シアノ、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3ハロアルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_1～C_3ハロアルコキシ、C_1～C_2アルコキシC_1～C_2アルキル、C_1～C_2アルキルカルボニル、及びC_3～C_4シクロアルキルから選択される１若しくは２個の置換基により任意に置換されていてもよいピラゾリルである。より好ましくは、R^4は、ハロゲン及びC_1～C_3ハロアルキル、好ましくは、クロロ及びトリフルオロメチルから選択されるただ一つの置換基により任意に置換されていてもよいピラゾリルである。

【００６１】

特に好ましい組の実施形態において、R^4は、３－（トリフルオロメチル）ピラゾール－１－イル、３－クロロピラゾール－１－イル、４－クロロピラゾール－１－イル、３－メチルピラゾール－１－イル、３－メトキシピラゾール－１－イル、３－イソプロポキシピラゾール－１－イル、３－シクロプロピルピラゾール－１－イル、３－フルオロピラゾール－１－イル、３－（メトキシメチル）ピラゾール－１－イル、３－アセチルピラゾール－１－イル、３－エトキシピラゾール－１－イル、３－（トリフルオロメチル）ピラゾール－１－イル、３－イソプロピルピラゾール－１－イル、６－フルオロ－３－メチル－インダゾール－１－イル、４－メトキシインダゾール－１－イル、５－フルオロインダゾール－１－イル、２，２－ジフルオロエトキシ）ピラゾール－１－イル、３－シアノピラゾール－１－イル、６－メトキシインダゾール－１－イル、７－フルオロインダゾール－２－イル、又は３－クロロ－１，２，４－トリアゾール－１－イルである。とりわけ好ましい組の実施形態は、R^4が、３－（トリフルオロメチル）ピラゾール－１－イル、３－クロロピラゾール－１－イル、又は４－クロロピラゾール－１－イルであるものである。

【００６２】

R^5は、水素、ハロゲン、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、又はC_3～C_6シクロアルキルである。好ましくは、R^5は、水素、ハロゲン、C_1～C_4アルキル、C_1～C_4ハロアルキル、又はC_3～C_6シクロアルキルである。より好ましくは、R^5は、水素、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3ハロアルキル、又はC_3～C_5シクロアルキルである。さらにより好ましくは、R^5は、水素、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、又はC_3～C_4シクロアルキルである。より好ましくはさらに、R^5は、水素又はC_1～C_3アルキルである。さらにより好ましくはさらに、R^5は、C_1～C_3アルキル、好ましくはメチルである。

【００６３】

R^7は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルキルスルファニル、C_1～C_6アルキルスルフィニル、C_1～C_6アルキルスルホニル、C_1～C_6アルキルスルホンアミド、C_1～C_6アルキルカルボニル、C_1～C_6アルコキシカルボニル、C_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル又はＮ，Ｎ－ジ（C_1～C_4アルキル）アミノカルボニルである。

【００６４】

好ましくは、R^7は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、C_1～C_4アルキル、C_1～C_4アルコキシ、C_1～C_4ハロアルキル、C_1～C_4ハロアルコキシ、C_1～C_4アルコキシC_1～C_3アルキル、C_1～C_4アルキルスルファニル、C_1～C_4アルキルスルフィニル、C_1～C_4アルキルスルホニル、C_1～C_4アルキルスルホンアミド、C_1～C_4アルキルカルボニル、C_1～C_4アルコキシカルボニル、C_1～C_4アルキルアミノカルボニル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル又はＮ，Ｎ－ジ（C_1～C_3アルキル）アミノカルボニルである。

【００６５】
より好ましくは、R^7は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_1～C_3ハロアルキル、C_1～C_3ハロアルコキシ、C_1～C_3アルコキシC_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルキルスルファニル、C_1～C_3アルキルスルフィニル、C_1～C_3アルキルスルホニル、C_1～C_3アルキルスルホンアミド、C_1～C_3アルキルカルボニル、C_1～C_3アルコキシカルボニル、C_1～C_3アルキルアミノカルボニル、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル又はＮ，Ｎ－ジ（C_1～C_3アルキル）アミノカルボニルである。
【００６６】
より好ましくはさらに、R^7は、シアノ、ニトロ、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_1～C_3ハロアルキル、C_1～C_3ハロアルコキシ、C_1～C_3アルコキシC_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルキルカルボニル、又はC_3～C_6シクロアルキルである。さらにより好ましくは、R^7は、シアノ、ニトロ、クロロ、フルオロ、メチル、イソプロピル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、２，２－ジフルオロエトキシ、メトキシメチル、アセチル、又はシクロプロピルである。
【００６７】
一組の実施形態において、R^7は、シアノ、ニトロ、又はハロゲン、好ましくはハロゲン、より好ましくはクロロ又はフルオロである。
【００６８】
R^9は、ホルミル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、ハロゲン、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_2～C_6アルケニルオキシ、シアノC_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6アルコキシカルボニルC_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6アルコキシカルボニル、C_1～C_6アルキルスルファニル、C_1～C_6アルキルスルフィニル、C_1～C_6アルキルスルホニル、C_1～C_6アルキルスルホンアミド、C_1～C_6アルキルカルボニル、C_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_1～C_6アルキルカルボニルアミノ、C_1～C_6アルキルアミノ、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキルカルボニルアミノ、C_2～C_6アルケニルカルボニルアミノ、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル、Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_4アルキル）アミノ、Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_4アルキル）アミノカルボニル、若しくはベンジルオキシであり；又は
いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、C_3～C_6シクロアルキル環又はフェニル環を形成し得、C_3～C_6シクロアルキル及びフェニル部分は、R^{10}により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、３若しくは４個の基で任意に置換されていてもよく；又は
いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロアリール環を形成し得、ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２、３若しくは４個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員芳香族環であり、ヘテロアリール部分は、R^{10}により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、３若しくは４個の基で任意に置換されていてもよく；又は
いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロシクリル環を形成し得、ヘテロシクリル部分は、Ｏ及びＮから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員であり、ヘテロアリール環は、R^{10}により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、３若しくは４個の基で任意に置換されていてもよい。
【００６９】
好ましくは、R^9は、ホルミル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、ハロゲン、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_2～C_6アルケニルオキシ、シアノC_1～C_4アルコキシ、C_1～C_4アルコキシC_1～C_4ア

ルキル、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルコキシ、C_1～C_4アルコキシカルボニルC_1～C_4アルコキシ、C_1～C_6アルコキシカルボニル、C_1～C_4アルキルスルファニル、C_1～C_4アルキルスルフィニル、C_1～C_4アルキルスルホニル、C_1～C_4アルキルスルホンアミド、C_1～C_6アルキルカルボニル、C_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_1～C_6アルキルカルボニルアミノ、C_1～C_6アルキルアミノ、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_1～C_4アルコキシC_1～C_4アルキルカルボニルアミノ、C_2～C_6アルケニルカルボニルアミノ、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル、N，N－ジ（C_1～C_3アルキル）アミノ、N，N－ジ（C_1～C_3アルキル）アミノカルボニル、若しくはベンジルオキシであり；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、C_3～C_6シクロアルキル環又はフェニル環を形成し得、C_3～C_6シクロアルキル及びフェニル部分は、R^{10}により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、若しくは３個の基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロアリール環を形成し得、ヘテロアリール部分は、N、O及びSから個々に選択される１、２、若しくは３個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員芳香族環であり、ヘテロアリール部分は、R^{10}により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、若しくは３個の基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロシクリル環を形成し得、ヘテロシクリル部分は、O及びNから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員であり、ヘテロシクリル環は、R^{10}により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、若しくは３個の基で任意に置換されていてもよい。

【００７０】

より好ましくは、R^9は、アセチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、ハロゲン、C_1～C_4アルキル、C_1～C_4アルコキシ、C_1～C_4ハロアルキル、C_1～C_4ハロアルコキシ、C_2～C_4アルケニルオキシ、シアノ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、C_1～C_4アルコキシC_1～C_4アルコキシ、C_1～C_4アルコキシカルボニル、C_1～C_4アルキルスルファニル、C_1～C_4アルキルスルホニル、C_1～C_4アルキルカルボニル、C_1～C_4アルキルカルボニルアミノ、C_1～C_4アルコキシイミノC_1～C_4アルキル、C_1～C_4アルコキシC_1～C_4アルキルカルボニルアミノ、C_2～C_4アルケニルカルボニルアミノ、C_3～C_4シクロアルキル、フェニル又はヘテロアリールであり、ヘテロアリール部分は、N、O及びSから個々に選択される１又は２個のヘテロ原子を含む５又は６員芳香族環であり、並びに、フェニル及びヘテロアリール部分は、R^{10}により表される同一であっても異なっていてもよい１又は２個の基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、C_5～C_6シクロアルキル環又はフェニル環を形成し得、C_5～C_6シクロアルキル及びフェニル部分は、R^{10}により表される同一であっても異なっていてもよい１又は２個の基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５又は６員ヘテロアリール環を形成し得、ヘテロアリール部分は、N、O及びSから個々に選択される１又は２個のヘテロ原子を含む５又は６員芳香族環であり、並びに、ヘテロアリール部分は、R^{10}により表される同一であっても異なっていてもよい１又は２個の基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５又は６員ヘテロシクリル環を形成し得、ヘテロシクリル部分は、O及びNから選択される１又は２個のヘテロ原子を含む５又は６員であり、ヘテロシクリル環は、R^{10}により表される同一であっても異なっていてもよい１又は２個の基で任意に置換されていてもよい。

【００７１】

さらにより好ましくは、R^9は、アセチル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、ハロゲン、C_1～C_4アルキル、C_1～C_4アルコキシ、C_1～C_3ハロアルキル、C_1～C_3ハロアルコキシ、C_2～C_3アルケニルオキシ、シアノC_1～C_2アルキル、C_1～C_3アルコキシC_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシC_1～C_3アルコキシ、C_1～C_2アルコキシカルボニル、C_1～C_2アルキルスルファニル、C_1～C_2アルキルスルホニル、C_1～C_3アルキルカルボニル、C_1～C_3アルキルカルボニルアミノ、C_1～C_2アルコキシイミノC_1～C_2アルキル、C_2～C_3アルケニルカルボニルアミノ、シクロプロピル、フェニル又はヘテロアリールであり、ヘテロアリール部分は、N、O及びSから個々に選択される１又は２個のヘテロ原子を含む５又は６員芳香族環であり、並びに、フェニル及びヘテロアリール部分は、単一のR^{10}基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、シクロヘキシル又はフェニル環を形成し得、フェニル部分は、R^{10}により表される同一であっても異なっていてもよい１又は２個の基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、ヘテロアリール環を形成し得、ヘテロアリール部分は単一の窒素原子を含む６員芳香族環であり、及び、ヘテロアリール部分は、単一のR^{10}基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５又は６員ヘテロシクリル環を形成し得、ヘテロシクリル部分は、O及びNから選択される１又は２個のヘテロ原子を含む５又は６員であり、並びに、ヘテロシクリル環は、単一のR^{10}基で任意に置換されていてもよい。

【００７２】

一組の実施形態において、R^9は、シアノ、ハロゲン、C_1～C_4アルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_1～C_3ハロアルキル、C_1～C_2ハロアルコキシ、C_1～C_3アルコキシC_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルキルカルボニル、若しくはC_3～C_4シクロアルキルであり；又はいずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、ただ一つのR^{10}基で任意に置換されていてもよいフェニル環を形成し得る。好ましくは、R^9は、シアノ、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、C_1～C_3アルコキシ、C_1～C_2ハロアルキル、C_1～C_2ハロアルコキシ、C_1～C_2アルコキシC_1～C_2アルキル、C_1～C_2アルキルカルボニル、若しくはC_3～C_4シクロアルキルであり；又はいずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、ただ一つのR^{10}基で任意に置換されていてもよいフェニル環を形成し得る。

【００７３】

R^{10}は、ハロゲン、C_1～C_3アルキル、又はC_1～C_3アルコキシである。好ましくは、R^{10}は、ハロゲン又はC_1～C_3アルコキシである。より好ましくは、R^{10}は、ハロゲン又はメトキシである。さらにより好ましくは、R^{10}は、フルオロ又はメトキシである。

【００７４】

本発明に係る式（Ｉ）の化合物において、好ましくは：

R^1はエチルであり；

R^2は、３，４－ジクロロフェニル又は３，４－ジフルオロフェニルであり；

R^4は、ヘテロアリールであり、ヘテロアリール部分は、２若しくは３個の窒素原子を含む５員芳香族単環式環であり、ヘテロアリール部分は、ヘテロアリール環中の窒素原子を介して分子の残部に結合しており、ヘテロアリール部分は、各々、R^9により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、若しくは３個の基で任意に置換されていてもよく；

R^5はメチルであり；

R^9は、ホルミル、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、ハロゲン、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシ、C_1～C_6ハロアルキル、C_1～C_6ハロアルコキシ、C_2～C_6アルケニルオキシ、シアノC_1～C_4アルコキシ、C_1～C_4アルコキシC_1～C_4アルキル、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルコキシ、C_1～C_4アルコキシカルボニルC_1～C_4アルコキシ、C_1～C_6アルコキシカルボニル、C_1～C_4アルキルスルファニル、C_1～C_4アル

キルスルフィニル、C_1～C_4アルキルスルホニル、C_1～C_4アルキルスルホンアミド、C_1～C_6アルキルカルボニル、C_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_1～C_6アルキルカルボニルアミノ、C_1～C_6アルキルアミノ、C_1～C_6アルコキシC_1～C_6アルキルアミノカルボニル、C_1～C_4アルコキシC_1～C_4アルキルカルボニルアミノ、C_2～C_6アルケニルカルボニルアミノ、C_3～C_6シクロアルキル、C_3～C_6シクロアルキルアミノカルボニル、Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_3アルキル）アミノ、Ｎ，Ｎ－ジ（C_1～C_3アルキル）アミノカルボニル、若しくはベンジルオキシであり；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、C_3～C_6シクロアルキル環又はフェニル環を形成し得、C_3～C_6シクロアルキル及びフェニル部分は、R^{10}により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、若しくは３個の基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロアリール環を形成し得、ヘテロアリール部分は、Ｎ、Ｏ及びＳから個々に選択される１、２、若しくは３個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員芳香族環であり、ヘテロアリール部分は、R^{10}により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、若しくは３個の基で任意に置換されていてもよく；又は

いずれかの隣接する２つのR^9基は、これらが結合する炭素原子と一緒になって、５員若しくは６員ヘテロシクリル環を形成し得、ヘテロシクリル部分は、Ｏ及びＮから選択される１若しくは２個のヘテロ原子を含む５員若しくは６員であり、ヘテロシクリル環は、R^{10}により表される、同一であっても異なっていてもよい、１、２、若しくは３個の基で任意に置換されていてもよく；

R^{10}は、ハロゲン又はC_1～C_3アルコキシである。

【００７５】

別の組の実施形態において、

R^1はエチルであり；

R^2は３，４－ジクロロフェニルであり；

R^4は、３－（トリフルオロメチル）ピラゾール－１－イル、３－クロロピラゾール－１－イル、又は４－クロロピラゾール－１－イルであり；

R^5はメチルである。

【００７６】

本発明の化合物は、以下のスキームにおいて示されているとおりに形成可能であり、ここでは、別段の定めがある場合を除き、各可変要素の定義は式（Ｉ）の化合物について上記に定義されているとおりである。式（Ｉ）の化合物を生成するための一般的な方法は以下に記載されている。文中に別段の定めがある場合を除き、R^1、R^2、R^4、及びR^5は、本明細書中において既に定義されているとおりである。本発明の化合物の調製に用いられる出発材料は、通常の商業的な供給業者から購入し得、又は、公知の方法により調製し得る。出発材料並びに中間体は、クロマトグラフィ、結晶化、蒸留及びろ過などの最先端の技法によって、次のステップにおいて使用される前に精製してもよい。

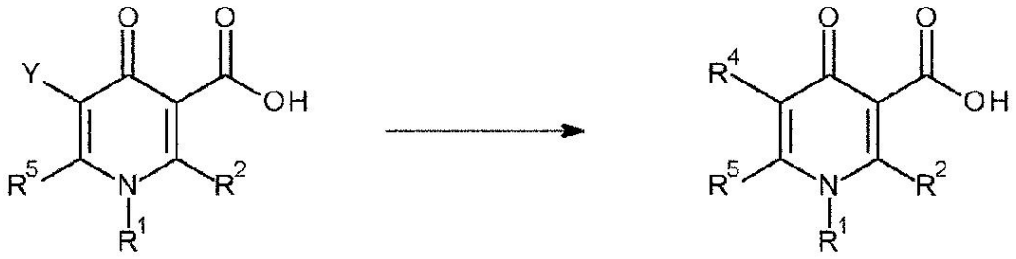
【００７７】

本発明に係る式（Ｉ）の化合物は、スキーム１において以下に示されているとおり式（Ａ）の化合物から調製され得る。

【００７８】

スキーム１：

【化２】



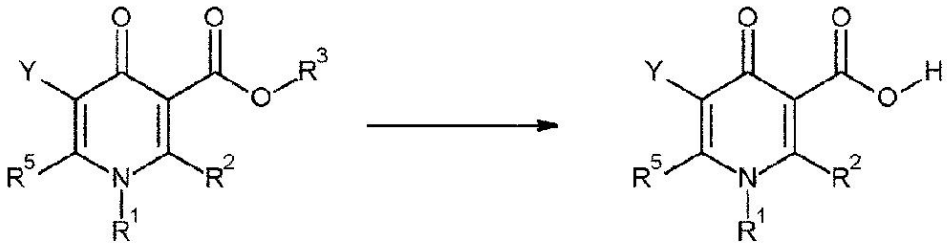
式(A) 式(I)

R^4が上記のとおり定義される式（Ｉ）の化合物は、ウルマン型クロスカップリング反応によって、ＹがＩ（ヨード）である式（Ａ）の化合物から調製され得る。典型的には、反応は、高温における好適な有機溶剤（ジメチルスルホキシドなど）中で、塩基（炭酸カリウムなど）の存在下に銅塩（ヨウ化銅（Ｉ）など）及び配位子（Ｎ，Ｎ’－ビス（２，６－ジメトキシフェニル）オキサミド）の存在下で、式（Ａ）の化合物と環状ＮＨヘテロサイクル（ピラゾールなど）との反応により行われる。これは上記のスキーム１に示されている。

【００７９】

スキーム２：

【化３】



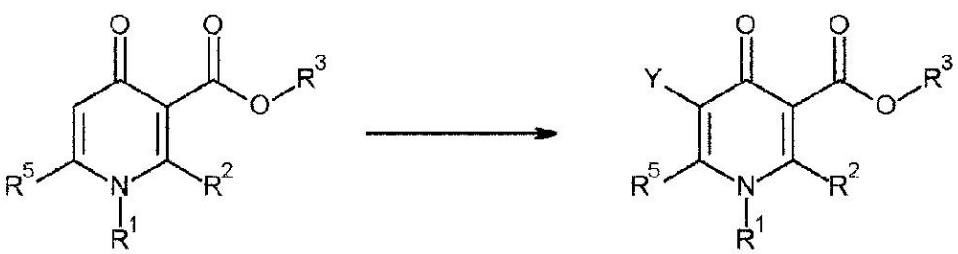
式(B) 式(A)

ＹがＩ（ヨード）である式（Ａ）の化合物は、任意の共溶剤（水など）を伴う、好適な溶剤（メタノール、エタノール、ジクロロメタン、クロロホルム、酢酸エチル又はテトラヒドロフランなど）中で、好適な塩基（水酸化ナトリウム又は水酸化リチウムなど）による又は好適な酸（トリフルオロ酢酸、塩酸、ギ酸又は硫酸など）による、R^3がC_1～C_6アルキルである式（Ｂ）の化合物の加水分解により調製され得る。これは上記のスキーム２に示されている。

【００８０】

スキーム３：

【化４】



式(C) 式(B)

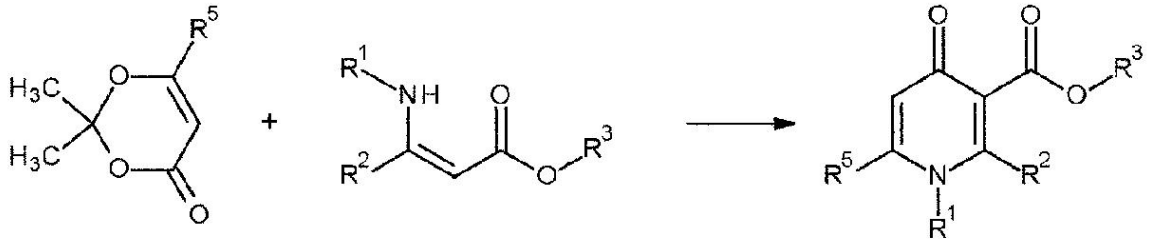
ＹがＩ（ヨード）である式（Ｂ）の化合物は、好適な溶剤（アセトニトリル又はトリフルオロ酢酸など）中で、好適なハロゲン化剤（Ｎ－ヨードスクシンイミドなど）による式

（Ｃ）の化合物の処理によって調製され得る。これは上記のスキーム３に示されている。

【００８１】

スキーム４：

【化５】



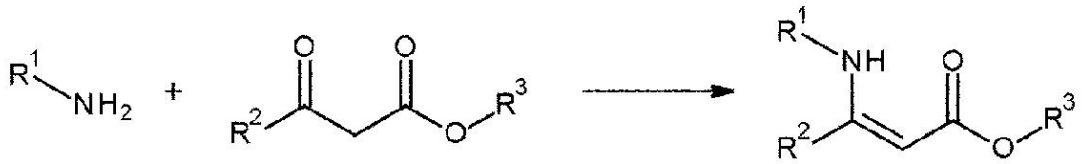
式(E)　　式(F)　　式(C)

式（Ｃ）の化合物は、高温（例えば１２０℃）において溶剤なしで式（Ｅ）の化合物を式（Ｆ）の化合物と反応させることによって調製され得る。式Ｅの化合物は、市販されているか、又は、当業者に知られている方法により調製され得る。これは上記のスキーム４に示されている。

【００８２】

スキーム５：

【化６】



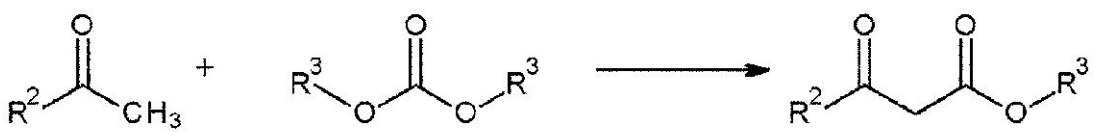
式(H)　　式(G)　　式(F)

式（Ｆ）の化合物は、式（Ｇ）のβ－ケトエステルとアミン塩との反応から調製され得る。アミン塩は、好適な酸（酢酸など）による、インサイチュでの式（Ｈ）のアミンの酸性化で調製可能である。これらのアミン塩は次いで、好適な溶剤（トルエンなど）中、酸（酢酸など）及び乾燥剤（４Å分子ふるいなど）の存在下で式（Ｇ）の化合物と反応させられ得る。式（Ｇ）の化合物は市販されているか、又は、以下に記載の条件を用いて調製され得る。式（Ｈ）の化合物は市販されているか、又は、当業者によく知られた方法により調製され得る。これは上記のスキーム５に示されている。

【００８３】

スキーム６：

【化７】



式(i)　　式(J)　　式(G)

式（Ｇ）の化合物は、式（Ｊ）のジアルキル炭酸塩（ジメチルカーボネートなど）の存在下における、塩基（水素化ナトリウムなど）による式（ｉ）のケトンの処理によって調製され得る。

【００８４】
式（ｉ）及び式（Ｊ）の化合物は、市販されているか、又は、当業者に知られている方法により調製され得る。これは上記のスキーム６に示されている。
【００８５】
本発明はさらに、生息地において雑草を防除する方法を提供するものであり、前記方法は、生息地に対する、雑草防除量の式（Ｉ）の化合物を含む組成物の適用を含む。しかも、本発明はさらに、有用な（作物）植物及び雑草が含まれる生息地において雑草を選択的に防除する方法を提供し得、ここで、この方法は、生息地に対する、雑草防除量の本発明に係る組成物の適用を含む。「防除」とは、駆除、成長の低減若しくは妨害、又は、発芽の防止若しくは低減を意味する。本発明の化合物は、公知の構造的に類似する化合物と比して、かなり向上した選択性を示すことに注目されたい。一般に、防除されるべき植物は、不要な植物（雑草）である。「生息地」とは、植物が成長しているか、又は、成長することとなる領域を意味する。施用は、作物植物の発芽前及び／又は発芽後に生息地に対して行われ得る。いく種かの作物植物は、式（Ｉ）の化合物による除草効果に対して先天的に耐性であり得る。
【００８６】
式（Ｉ）の化合物の施用量は広い限度内において様々であり得、土壌の性質、適用方法（発芽前又は発芽後；種子粉衣；蒔き溝への適用；耕耘適用無し等）、作物植物、防除されるべき雑草、卓越的気象条件、並びに、適用方法、適用時期及び標的作物によって左右される他の要因に応じる。本発明に係る式Ｉの化合物は一般に、１０～２５００ｇ／ｈａ、特に２５～１０００ｇ／ｈａ、特に２５～２５０ｇ／ｈａの量で適用される。
【００８７】
適用は一般に、典型的にはトラクタに備え付けた大面積用噴霧器によって組成物を吹き付けることにより行われるが、散粉（粉末の場合）、滴下又は潅注などの他の方法もまた使用可能である。
【００８８】
「有用な植物」という用語はまた、従来の交配又は遺伝子操作法によって、ブロモキシニルのような除草剤、又は、例えば、４－ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ（ＨＰＰＤ）阻害剤、ＡＬＳ阻害剤、例えばプリミスルフロン、プロスルフロン及びトリフロキシスルフロン、５－エノール－ピロビル－シキメート－３－リン酸塩－シンターゼ（ＥＰＳＰＳ）阻害剤、グルタミンシンテターゼ（ＧＳ）阻害剤若しくはプロトポルフィリノーゲン－オキシダーゼ（ＰＰＯ）阻害剤などのある分類の除草剤に対する耐性がもたらされた有用な植物を含むと理解されるべきである。従来の交配方法（突然変異誘発）によって、例えばイマザモックスといったイミダゾリノンに対する耐性がもたらされた作物の一例は、Ｃｌｅａｒｆｉｅｌｄ（登録商標）夏ナタネ（カノーラ）である。遺伝子操作方法によって除草剤又はあるクラスの除草剤に対する耐性がもたらされた作物の例としては、商品名ＲｏｕｎｄｕｐＲｅａｄｙ（登録商標）、Ｈｅｒｃｕｌｅｘ　Ｉ（登録商標）及びＬｉｂｅｒｔｙＬｉｎｋ（登録商標）で市販されているグリホサート－及びグルホシネート－耐性トウモロコシ品種が挙げられる。
【００８９】
「有用な植物」という用語は、例えば、特にバチルス属（Ｂａｃｉｌｌｕｓ）のものといったトキシン－産生バクテリア由来の公知のものなどの１種以上の選択的に作用するトキシンを合成可能であるよう、組み換えＤＮＡ技術を用いて形質転換された有用な植物をも含むと理解されるべきである。
【００９０】
このような植物の例は、ＹｉｅｌｄＧａｒｄ（登録商標）（ＣｒｙＩＡ（ｂ）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；ＹｉｅｌｄＧａｒｄ根食い線虫（登録商標）（ＣｒｙＩＩＩＢ（ｂ１）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；ＹｉｅｌｄＧａｒｄ　Ｐｌｕｓ（登録商標）（ＣｒｙＩＡ（ｂ）及びＣｒｙＩＩＩＢ（ｂ１）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；Ｓｔａｒｌｉｎｋ（登録商標）（Ｃｒｙ９（ｃ）トキシンを発現するトウ

モロコシ品種）；Ｈｅｒｃｕｌｅｘ　Ｉ（登録商標）（ＣｒｙＩＦ（ａ２）トキシン及び酵素ホスフィノトリシンＮ－アセチルトランスフェラーゼ（ＰＡＴ）を発現して、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成しているトウモロコシ品種）；ＮｕＣＯＴＮ　３３Ｂ（登録商標）（ＣｒｙＩＡ（ｃ）トキシンを発現する綿品種）；Ｂｏｌｌｇａｒｄ　Ｉ（登録商標）（ＣｒｙＩＡ（ｃ）トキシンを発現する綿品種）；Ｂｏｌｌｇａｒｄ　ＩＩ（登録商標）（ＣｒｙＩＡ（ｃ）及びＣｒｙＩＩＡ（ｂ）トキシンを発現する綿品種）；ＶＩＰＣＯＴ（登録商標）（ＶＩＰトキシンを発現する綿品種）；ＮｅｗＬｅａｆ（登録商標）（ＣｒｙＩＩＩＡトキシンを発現するジャガイモ品種）；ＮａｔｕｒｅＧａｒｄ（登録商標）Ａｇｒｉｓｕｒｅ（登録商標）ＧＴ利点（ＧＡ２１グリホサート耐性形質）、Ａｇｒｉｓｕｒｅ（登録商標）ＣＢ利点（Ｂｔ１１コーン穿孔性害虫（ＣＢ）形質）、Ａｇｒｉｓｕｒｅ（登録商標）ＲＷ（コーン根食い線虫形質）及びＰｒｏｔｅｃｔａ（登録商標）である。

【００９１】

植物作物又はその種子材料は共に、除草剤に耐性であると共に、同時に、昆虫による摂食（「スタック型」トランスジェニックイベント）に耐性であることが可能である。例えば、種子は、殺虫性Ｃｒｙ３タンパク質発現能を有する一方で、同時に、グリホサートに耐性であることが可能である。

【００９２】

作物植物はまた、交配又は遺伝子操作に係る従来の方法により得ることが可能であると共に、いわゆる出力形質（例えば向上した保管安定性、より高い栄養価、及び、向上した風味）を含むものを含むと理解されるべきである。

【００９３】

式（Ｉ）の化合物（又はこれを含む組成物）は、不要な植物（総括して「雑草」）の防除に用いることが可能である。防除される雑草は、例えばアグロスチス属（Ａｇｒｏｓｔｉｓ）、スズメノテッポウ属（Ａｌｏｐｅｃｕｒｕｓ）、カラスムギ属（Ａｖｅｎａ）、ブラキアリア属（Ｂｒａｃｈｉａｒｉａ）、スズメノチャヒキ属（Ｂｒｏｍｕｓ）、ケンクルス属（Ｃｅｎｃｈｒｕｓ）、カヤツリグサ属（Ｃｙｐｅｒｕｓ）、メヒシバ属（Ｄｉｇｉｔａｒｉａ）、エキノクロア属（Ｅｃｈｉｎｏｃｈｌｏａ）、オヒシバ属（Ｅｌｅｕｓｉｎｅ）、ドクムギ属（Ｌｏｌｉｕｍ）、モノコリア属（Ｍｏｎｏｃｈｏｒｉａ）、ロットボエリア属（Ｒｏｔｔｂｏｅｌｌｉａ）、オモダカ属（Ｓａｇｉｔｔａｒｉａ）、ホタルイ属（Ｓｃｉｒｐｕｓ）、セタリア属（Ｓｅｔａｒｉａ）及びモロコシ属（Ｓｏｒｇｈｕｍ）といった単子葉種、並びに、例えばイチビ属（Ａｂｕｔｉｌｏｎ）、アマランサス属（Ａｍａｒａｎｔｈｕｓ）、ブタクサ属（Ａｍｂｒｏｓｉａ）、アカザ属（Ｃｈｅｎｏｐｏｄｉｕｍ）、キク属（Ｃｈｒｙｓａｎｔｈｅｍｕｍ）、イズハハコ属（Ｃｏｎｙｚａ）、ヤエムグラ属（Ｇａｌｉｕｍ）、サツマイモ属（Ｉｐｏｍｏｅａ）、オランダガラシ属（Ｎａｓｔｕｒｔｉｕｍ）、シダ属（Ｓｉｄａ）、シロガラシ属（Ｓｉｎａｐｉｓ）、ナス属（Ｓｏｌａｎｕｍ）、ハコベ属（Ｓｔｅｌｌａｒｉａ）、クワガタソウ属（Ｖｅｒｏｎｉｃａ）、ビオラ属（Ｖｉｏｌａ）及びオナモミ属（Ｘａｎｔｈｉｕｍ）といった双子葉種の両方であり得る。

【００９４】

式（Ｉ）の化合物は、未変性の形態で使用され得るか、又は、好ましくは、除草組成物を提供するために配合物の当該技術分野において従来採用されている補助剤と一緒に、キャリア、溶剤及び表面活性薬剤（ＳＡＡ）などの配合補助剤を用いて、使用され得る。本発明は従って、少なくとも１種の式（Ｉ）の化合物と、農学的に許容可能なキャリアと、任意に補助剤とを含む除草組成物をさらに提供する。農業的に許容可能なキャリアは、例えば農業用の使用に好適なキャリアである。農業用キャリアは、当該技術分野において周知である。

【００９５】

除草組成物は一般に、０．１～９９重量％、特に０．１～９５重量％の式Ｉの化合物と、好ましくは０～２５重量％の表面活性物質を含む１～９９．９重量％の配合補助剤とを

含む。

【００９６】

組成物は、多数の配合物タイプから選択可能である。これらとしては、エマルジョン濃縮物（ＥＣ）、懸濁液濃縮物（ＳＣ）、サスポエマルジョン（ＳＥ）、カプセル懸濁液（ＣＳ）、水分散性顆粒（ＷＧ）、乳化性顆粒（ＥＧ）、油中水型エマルジョン（ＥＯ）、水中油型エマルジョン（ＥＷ）、マイクロ－エマルジョン（ＭＥ）、油分散体（ＯＤ）、混油性フロアブル剤（ＯＦ）、混油性液体（ＯＬ）、可溶性濃縮物（ＳＬ）、超低体積懸濁液（ＳＵ）、超低体積液体（ＵＬ）、工業用濃縮物（ＴＫ）、分散性濃縮物（ＤＣ）、可溶性粉末（ＳＰ）、水和剤（ＷＰ）及び可溶性顆粒（ＳＧ）が挙げられる。いずれかの事例において選択される配合物タイプは、想定される特定の目的、並びに、式（Ｉ）の化合物の物理的、化学的及び生物学的特性に応じることとなる。

【００９７】

可溶性粉末（ＳＰ）は、式（Ｉ）の化合物を、１種以上の水溶性無機塩（重炭酸ナトリウム、炭酸ナトリウム又は硫酸マグネシウムなど）若しくは１種以上の水溶性有機固形分（多糖類など）、及び、任意により、１種以上の湿潤剤、１種以上の分散剤、又は、前記薬剤の混合物と混合して、水への分散性／溶解度を向上させることにより調製され得る。次いで、混合物は微粉末に粉砕される。同様の組成物を粒状化して、水溶性顆粒（ＳＧ）を形成することもできる。

【００９８】

水和剤（ＷＰ）は、式（Ｉ）の化合物を、１種以上の固体希釈剤又はキャリア、１種以上の湿潤剤、並びに、好ましくは、１種以上の分散剤、及び、任意により、１種以上の懸濁剤と混合して、液体における分散性を促進させることにより調製され得る。次いで、混合物は微粉末に粉砕される。同様の組成物が粒状化されて、水分散性顆粒（ＷＧ）が形成されてもよい。

【００９９】

顆粒（ＧＲ）は、式（Ｉ）の化合物と、１種以上の粉末固体希釈剤若しくはキャリアとの混合物を造粒することにより形成され得、又は、式（Ｉ）の化合物（又は、好適な薬剤中のその溶液）を多孔性の顆粒状材料（軽石、アタパルジャイトクレイ、フーラー土、キースラガー、珪藻土又は粉砕されたトウモロコシ穂軸など）中に吸収させ、若しくは、式（Ｉ）の化合物（又は、好適な薬剤中のその溶液）を硬質の核材料（砂、ケイ酸、炭酸塩鉱物、硫酸塩又はリン酸塩など）に吸収させ、必要に応じて乾燥させることにより予め形成されている圧縮粉顆粒から形成され得る。吸収又は吸着を助けるために通常用いられる薬剤としては、溶剤（脂肪族及び芳香族石油溶剤、アルコール、エーテル、ケトン、並びに、エステルなど）及び固着材（ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、デキストリン、糖質及び植物油など）が挙げられる。１種以上の他の添加剤もまた顆粒中に含まれていてもよい（例えば、乳化剤、湿潤剤又は分散剤）。

【０１００】

分散性濃縮物（ＤＣ）は、式（Ｉ）の化合物を水、又は、ケトン、アルコール或いはグリコールエーテルなどの有機溶剤中に溶解させることにより調製され得る。これらの溶液は、表面活性剤を含有していてもよい（例えば、水による希釈を向上させるか、又は、噴霧タンク中での結晶化を防止するため）。

【０１０１】

乳化性濃縮物（ＥＣ）又は水中油型エマルジョン（ＥＷ）は、式（Ｉ）の化合物を有機溶剤（任意により、１種以上の湿潤剤、１種以上の乳化剤又は前記薬剤の混合物を有する）中に溶解させることにより調製され得る。ＥＣにおいて好適に用いられる有機溶剤としては、芳香族炭化水素（ＳＯＬＶＥＳＳＯ　１００、ＳＯＬＶＥＳＳＯ　１５０及びＳＯＬＶＥＳＳＯ　２００（ＳＯＬＶＥＳＳＯは登録商標である）により例示されるアルキルベンゼン又はアルキルナフタレンなど）、ケトン（シクロヘキサノン又はメチルシクロヘキサノンなど）、及び、アルコール（ベンジルアルコール、フルフリルアルコール又はブタノールなど）、Ｎ－アルキルピロリドン（Ｎ－メチルピロリドン又はＮ－オクチルピロ

リドンなど）、脂肪酸のジメチルアミド（C_8～C_{10}脂肪酸ジメチルアミドなど）、及び、塩素化炭化水素が挙げられる。ＥＣ生成物は、水に添加されると自然に乳化して、適切な器具での噴霧用途が可能なほどに十分な安定性を有するエマルジョンをもたらし得る。

【０１０２】

ＥＷの調製では、液体（室温で液体ではない場合には、典型的には７０℃未満といった適切な温度で溶融されていてもよい）として、又は、溶液（適切な溶剤中に溶解させることにより）で式（Ｉ）の化合物を得、次いで、得られた液体又は溶液が１種以上のＳＡＡを含有する水中に、高せん断下で乳化してエマルジョンがもたらされる。ＥＷにおいて好適に用いられる溶剤としては、植物油、塩素化炭化水素（クロロベンゼンなど）、芳香族溶剤（アルキルベンゼン又はアルキルナフタレンなど）、及び、水への溶解度が低い他の適切な有機溶剤が挙げられる。

【０１０３】

ミクロエマルジョン（ＭＥ）は、１種以上の溶剤と１種以上のＳＡＡとのブレンドを水と混合して、熱力学的に安定な等方性液体配合物を自然にもたらすことにより調製され得る。式（Ｉ）の化合物は、最初は、水又は溶剤／ＳＡＡブレンドのいずれかの中に存在している。ＭＥにおいて好適に用いられる溶剤としては、ＥＣ又はＥＷにおける使用について前述されているものが挙げられる。ＭＥは、水中油型又は油中水型系のいずれかであり得（どちらの系が存在しているかは、伝導率の測定によって判定され得る）、同一の配合物中の水溶性及び油溶性有害生物防除剤の混合に好適であればよい。ＭＥは、マイクロエマルジョンのままで、又は、従来の水中油型エマルジョンを形成して水中に好適に希釈される。

【０１０４】

懸濁液濃縮物（ＳＣ）は、式（Ｉ）の化合物の微細な不溶性固体粒子の水性又は不水性懸濁液を含んでいてもよい。ＳＣは、式（Ｉ）の固体化合物を、好適な媒体中で、任意により１種以上の分散剤と共にボールミル又はビーズミルにかけて、化合物の微細な粒子懸濁液をもたらすことにより調製され得る。１種以上の湿潤剤が組成物中に含まれていてもよく、懸濁剤が、粒子の沈降速度を低減するために含まれていてもよい。或いは、式（Ｉ）の化合物は、乾式ミルにかけられ、及び、明細書中に上述されている薬剤を含有する水に添加されることにより、所望の最終生成物がもたらされてもよい。

【０１０５】

エアロゾル配合物は、式（Ｉ）の化合物及び好適な噴射剤（例えばｎ－ブタン）を含む。式（Ｉ）の化合物はまた、好適な媒体（例えば水、又は、ｎ－プロパノールなどの水和性の液体）中に溶解又は分散されて、非加圧式の手動噴霧ポンプにおける使用のための組成物がもたらされてもよい。

【０１０６】

カプセル懸濁液（ＣＳ）は、ＥＷ配合物の調製と同様に調製され得るが、油滴の各々が高分子シェルに内包されており、式（Ｉ）の化合物と、任意により、これのためのキャリア又は希釈剤とが含有されている、油滴の水性分散体が得られるような追加の重合ステージが伴う。高分子シェルは、界面重縮合反応若しくはコアセルベーション手法の一方により生成され得る。組成物は式（Ｉ）の化合物の徐放をもたらし得、種子処理に用いられ得る。式（Ｉ）の化合物はまた、生分解性高分子マトリックス中に配合されて、化合物がゆっくりとした徐放性とされてもよい。

【０１０７】

組成物は、例えば、式（Ｉ）の化合物の濡れ性、保持性若しくは表面上での分布性；被処理表面上での雨に対する耐性；又は、摂取若しくは易動性を向上させることにより、組成物の生物学的性能を向上するために、１種以上の添加剤を含んでいてもよい。このような添加剤としては、表面活性剤（ＳＡＡ）、例えば一定の鉱油又は天然の植物油（大豆油及びナタネ油など）といった油系の噴霧添加剤、メチル化ナタネ油（ＭＲＳＯ）などの変性植物油、及び、これらと他の生体活性増強（ｂｉｏ－ｅｎｈａｎｃｉｎｇ）補助剤（式（Ｉ）の化合物の作用を補助若しくは改変し得る処方成分）とのブレンドが挙げられる。

【０１０８】
湿潤剤、分散剤及び乳化剤は、カチオン性、アニオン性、両性又はノニオン性のＳＡＡであり得る。
【０１０９】
好適なカチオン性のＳＡＡとしては、第四級アンモニウム化合物（例えばセチルトリメチルアンモニウムブロミド）、イミダゾリン及びアミン塩が挙げられる。
【０１１０】
好適なアニオン性ＳＡＡとしては、脂肪酸のアルカリ金属塩、脂肪族モノエステルの硫酸塩（例えばラウリル硫酸ナトリウム）、スルホン化芳香族化合物の塩（例えばドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム、ブチルナフタレンスルホネート、及び、ジ－イソプロピル－ナフタレンスルホン酸ナトリウムとトリ－イソプロピル－ナフタレンスルホン酸ナトリウムとの混合物）、エーテル硫酸塩、アルコールエーテル硫酸塩（例えばラウレス－３硫酸ナトリウム）、エーテルカルボキシレート（例えばラウレス－３炭酸ナトリウム）、リン酸エステル（例えば、ラウリルアルコールと四リン酸との反応といった１種以上の脂肪族アルコールとリン酸（主にモノエステル）又は五酸化リン（主にジ－エステル）との反応からの生成物；また、これらの生成物はエトキシル化されていてもよい）、スルホスクシナメート、パラフィン又はオレフィンスルホン酸塩、タウレート、リグノスルホネート、及び、トリスチリルフェノールのリン酸塩／硫酸塩が挙げられる。
【０１１１】
好適な両性ＳＡＡとしては、ベタイン、プロピオネート、及び、グリシネートが挙げられる。好適なノニオン性のＳＡＡとしては、エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシド、又は、これらの混合物などのアルキレンオキシドと、脂肪族アルコール（オレイルアルコール又はセチルアルコールなど）若しくはアルキルフェノール（オクチルフェノール、ノニルフェノール又はオクチルクレゾールなど）との縮合物；長鎖脂肪酸又はヘキシトール無水物由来の部分エステル；前記部分エステルとエチレンオキシドとの縮合物；ブロックポリマー（エチレンオキシド及びプロピレンオキシドを含む）；アルカノールアミド；単純エステル（例えば脂肪酸ポリエチレングリコールエステル）；アミンオキシド（例えばラウリルジメチルアミンオキシド）；レシチン並びにそのソルビタン及びエステル、アルキルポリグリコシド及びトリスチリルフェノールが挙げられる。好適な懸濁剤としては、親水性コロイド（多糖類、ポリビニルピロリドン又はナトリウムカルボキシメチルセルロースなど）及び膨潤粘土（ベントナイト又はアタパルジャイトなど）が挙げられる。
【０１１２】
本発明の化合物はまた、１種以上の追加の除草剤及び／又は植物成長調整剤との混合物において用いることが可能である。このような追加の除草剤又は植物成長調整剤の例としては、アセトクロール、アシフルオルフェン（アシフルオルフェン－ナトリウムを含む）、アクロニフェン、アメトリン、アミカルバゾン、アミノピラリド、アミノトリアゾール、アトラジン、ベフルブタミド－Ｍ、ベンキトリオン、ベンスルフロン（ベンスルフロン－メチルを含む）、ベンタゾン、ビシクロピロン、ビラナホス、ビピラゾン、ビスピリバック－ナトリウム、ビクスロゾン、ブロクロゾン、ブロマシル、ブロモキシニル、ブタクロール、ブタフェナシル、カルフェントラゾン（カルフェントラゾン－エチルを含む）、クロランスラム（クロランスラム－メチルを含む）、クロリムロン（クロリムロン－エチルを含む）、クロロトルロン、クロルスルフロン、シンメチリン、クラシホス、クレトジム、クロジナホップ（クロジナホップ－プロパルギルを含む）、クロマゾン、クロピラリド、シクロピラニル、シクロピリモレート、シクロスルファムロン、シハロホップ（シハロホップ－ブチルを含む）、２，４－Ｄ（そのコリン塩及び２－エチルヘキシルエステルを含む）、２，４－ＤＢ、デスメディファム、ジカンバ（そのアルミニウム、アミノプロピル、ビス－アミノプロピルメチル、コリン、ジクロロプロプ、ジグリコールアミン、ジメチルアミン、ジメチルアンモニウム、カリウム及びナトリウム塩を含む）　ジクロスラ

ム、ジフルヘニカン、ジフルフェンゾピル、ジメタクロール、ジメテナミド－Ｐ、ジオキソピリトリオン、ダイコートジブロミド、ジウロン、エピリフェナシル、エタルフルラリン、エトフメセート、フェノキサプロップ（フェノキサプロップ－Ｐ－エチルを含む）、フェノキサスルフォン、フェンピラゾン、フェンキノトリオン、フェントラザミド、フラザスルフロン、フロラスラム、フロルピラウキシフェン（フロルピラウキシフェン－ベンジルを含む）、フルアジホップ（フルアジホップ－Ｐ－ブチルを含む）、フルカルバゾン（フルカルバゾン－ナトリウムを含む）、フルクロラミノピル（フルクロラミノ－テフリルを含む）、フルフェナセット、フルフェノキシマシル、フルメツラム、フルミオキサジン、フルオメツロン、フォメサフェン　フルピルスルフロン（フルピルスルフロン－メチル－ナトリウムを含む）、フルロキシピル（フルロキシピル－メプチルを含む）、フルスルフィナム、フォメサフェン、ホラムスルフロン、グルホシネート（Ｌ－グルホシネート及び両方のアンモニウム塩を含む）、グリホサート（そのジアンモニウム、イソプロピルアンモニウム及びカリウム塩を含む）、ハラウキシフェン（ハラウキシフェン－メチルを含む）、ハロキシホップ（ハロキシホップ－メチルを含む）、ヘキサジノン、ヒダントシジン、イカフォリン（イカフォリン－メチルを含む）、イマザモックス（Ｒ－イマザモックスを含む）、イマザピック、イマザピル、イマゼタピル、インダジフラム、インドラウキシピル（インドラウキシピル－シアノメチルを含む）、イオドスルフロン（イオドスルフロン－メチル－ナトリウムを含む）、イオフェンスルフロン（イオフェンスルフロン－ナトリウムを含む）、アイオキシニル、イプトリアゾピリド、イソプロツロン、イソキサフルトール、ランコトリオン、ＭＣＰＡ、ＭＣＰＢ、メコプロップ－Ｐ、メソスルフロン（メソスルフロン－メチルを含む）、メソトリオン、メタミトロン、メタザクロール、メチオゾリン、メトラクロール、メトスラム、メトリブジン、メトスルフロン、ナプロパミド、ニコスルフロン、ノルフルラゾン、オキサジアゾン、オキサスルフロン、オキシフルオルフェン、パラコートジクロリド、ペンディメタリン、ペノキススラム、フェンメディファム、ピクロラム、ピノキサデン、プレチラクロール、プリミスルフロン－メチル、プロメトリン、プロパニル、プロパキザホップ、プロピリスルフロン、プロピザミド、プロスルホカルブ、プロスルフロン、ピラクロニル、ピラフルフェン（ピラフルフェン－エチルを含む）、ピラクイネート、ピラスルホトール、ピリデート、ピリフタリド、ピリフルベンゾキシム、ピリミスルファン、ピロキサスルホン、ピロキシスラム、キンクロラック、キンメラック、キザロホップ（キザロホップ－Ｐ－エチル及びキザロホップ－Ｐ－テフリルを含む）、リミソキサフェン、リムスルフロン、サフルフェナシル、セトキシジム、シマジン、Ｓ－メタロクロール（Ｓ－ｍｅｔａｌｏｃｈｌｏｒ）、スルフェントラゾン、スルホスルフロン、テブチウロン、テフリルトリオン、テンボトリオン、テルブチラジン、テルブトリン、テトフルピロリメト、チエンカルバゾン、チフェンスルフロン、チアフェナシル、トルピラレート、トプラメゾン、トラルコキシジム、トリアファモネ、トリアレート、トリアスルフロン、トリベヌロン（トリベヌロン－メチルを含む）、トリクロピル、トリフロキシスルフロン（トリフロキシスルフロン－ナトリウムを含む）、トリフルジモキサジン、トリフルラリン、トリフルスルフロン、トリピラスルホン、３－（２－クロロ－４－フルオロ－５－（３－メチル－２，６－ジオキソ－４－トリフルオロメチル－３，６－ジヒドロピリミジン－１（２Ｈ）－イル）フェニル）－５－メチル－４，５－ジヒドロイソオキサゾール－５－カルボン酸エチルエステル、４－ヒドロキシ－１－メトキシ－５－メチル－３－［４－（トリフルオロメチル）－２－ピリジル］イミダゾリジン－２－オン、４－ヒドロキシ－１，５－ジメチル－３－［４－（トリフルオロメチル）－２－ピリジル］イミダゾリジン－２－オン、５－エトキシ－４－ヒドロキシ－１－メチル－３－［４－（トリフルオロメチル）－２－ピリジル］イミダゾリジン－２－オン、４－ヒドロキシ－１－メチル－３－［４－（トリフルオロメチル）－２－ピリジル］イミダゾリジン－２－オン、４－ヒドロキシ－１，５－ジメチル－３－［１－メチル－５－（トリフルオロメチル）ピラゾール－３－イル］イミダゾリジン－２－オン、（４Ｒ）１－（５－ｔｅｒｔ－ブチルイソオキサゾール－３－イル）－４－エトキシ－５－ヒドロキシ－３－メチル－イミダゾリジン－２－オン、（１ＲＳ，５ＳＲ）－３－［２－メトキシ－４－（

プロパ－１－イン－１－イル）フェニル］－４－オキソビシクロ［３．２．１］オクタ－２－エン－２－イル　メチルカーボネート，エチル－２－［［３－［［３－クロロ－５－フルオロ－６－［３－メチル－２，６－ジオキソ－４－（トリフルオロメチル）ピリミジン－１－イル］－２－ピリジル］オキシ］アセテート、メチル　２－［２－［２－ブロモ－４－フルオロ－５－［３－メチル－２，６－ジオキソ－４－（トリフルオロメチル）ピリミジン－１－イル］フェノキシ］フェノキシ］－２－メトキシ－アセテート、６－クロロ－４－（２，７－ジメチル－１－ナフチル）－５－ヒドロキシ－２－メチル－ピリダジン－３－オン、（２－フルオロフェニル）メチル　６－アミノ－５－クロロ－２－（４－クロロ－２－フルオロ－３－メトキシ－フェニル）ピリミジン－４－カルボキシレート、６－アミノ－５－クロロ－２－（４－クロロ－２－フルオロ－３－メトキシ－フェニル）ピリミジン－４－カルボン酸、及びメチル　３－［２－クロロ－５－［３，６－ジヒドロ－３－メチル－２，６－ジオキソ－４－（トリフルオロメチル）－１（２Ｈ）－ピリミジニル］－４－フルオロフェニル］－３ａ，４，５，６－テトラヒドロ－６－メチル－６ａＨ－シクロペンタ［ｄ］イソオキサゾール－６ａ－カルボキシレートが挙げられる。

【０１１３】

式（Ｉ）の化合物の混合相手はまた、例えばＴｈｅ　Ｐｅｓｔｉｃｉｄｅ　Ｍａｎｕａｌ，Ｎｉｎｅｔｅｅｎｔｈ　Ｅｄｉｔｉｏｎ，Ｂｒｉｔｉｓｈ　Ｃｒｏｐ　Ｐｒｏｔｅｃｔｉｏｎ　Ｃｏｕｎｃｉｌ，２０２１において記載されているとおり、エステル又は塩の形態であってもよい。

【０１１４】

混合物は、上記の配合物において有利に用いられることが可能である（この場合、「有効成分」は式（Ｉ）の化合物と混合相手とのそれぞれの混合物に関連する）。

【０１１５】

本発明の化合物又は混合物は、１種以上の除草剤毒性緩和剤と組み合わせても使用可能である。このような毒性緩和剤の例としては、ベノキサコール、クロキントセット（クロキントセットメキシルを含む）、シプロスルファミド、ジクロルミド、フェンクロラゾール（フェンクロラゾール－エチルを含む）、フェンクロリム、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン（イソキサジフェン－エチルを含む）、メフェンピル（メフェンピル－ジエチルを含む）、メトカミフェン及びオキサベトリニルが挙げられる。式Ｉの化合物と、シプロスルファミド、イソキサジフェン－エチル、クロキントセットメキシル及び／又はメトカミフェンとの混合物が特に好ましい。

【０１１６】

式（Ｉ）の化合物の毒性緩和剤はまた、例えばＴｈｅ　Ｐｅｓｔｉｃｉｄｅ　Ｍａｎｕａｌ，１９th　Ｅｄｉｔｉｏｎ（ＢＣＰＣ），２０２１に記載されているとおり、エステル又は塩の形態であり得る。クロキントセットメキシルに対する言及はまた、国際公開第０２／３４０４８号に開示されているとおり、そのリチウム、ナトリウム、カリウム、カルシウム、マグネシウム、アルミニウム、鉄、アンモニウム、第四級アンモニウム、スルホニウム又はホスホニウム塩にも適用される。

【０１１７】

好ましくは、式（Ｉ）の化合物対毒性緩和剤の混合比は、１００：１～１：１０、特に２０：１～１：１である。

【０１１８】

式（Ｉ）の化合物は通常農薬組成物の形態で用いられ、処理されるべき作物領域又は植物に、さらなる化合物と同時に、又は、順次に適用されることが可能である。これらのさらなる化合物は、例えば肥料若しくは微量元素供与物、又は、植物の成長に影響を及ぼす他の調製物であることが可能である。これらはまた、選択的な除草剤若しくは非選択的な除草剤、並びに、殺虫剤、殺菌・殺カビ剤、殺菌剤、殺線虫剤、軟体動物駆除剤、又は、これらの調製物の数種の混合物であることが可能であり、所望の場合には配合物の当該技術分野において慣例的に利用されるさらなるキャリア、界面活性剤若しくは適用促進補助剤を伴うことが可能である。

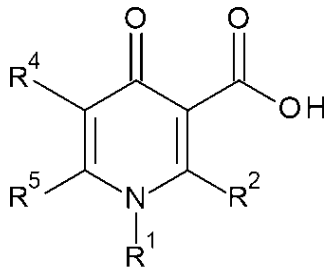
【０１１９】
本明細書において用いられる場合、「生息地」という用語は、植物が成長している圃場、又は栽培されている植物の種子が播種された圃場、又は種子が土壌に蒔かれることとなる圃場を意味する。これは、土壌、種子及び実生並びに確立した植生を含む。
【０１２０】
「植物」という用語は、種子、実生、苗、根、塊茎、茎、柄、群葉及び果実を含む植物のすべての物理的な部分を指す。
【０１２１】
「植物繁殖材料」という用語は、その増殖に用いられ得る種子などの植物の生殖部及び挿し木若しくは例えばジャガイモといった塊茎などの栄養体を表すと理解される。例えば種子（厳密な意味で）、根、果実、塊茎、鱗茎、根茎及び植物の部分が挙げられ得る。発芽後若しくは土壌から出芽した後に移植されることとなる発芽した植物及び若芽も挙げられる。これらの若芽は、移植前に浸漬による完全又は部分的な処置によって保護され得る。好ましくは、「植物繁殖材料」は、種子を表すと理解される。
【０１２２】
慣用名を用いて本明細書において言及される殺有害生物剤は、例えば、“Ｔｈｅ Ｐｅｓｔｉｃｉｄｅ Ｍａｎｕａｌ”，１５ｔｈ Ｅｄ．，Ｂｒｉｔｉｓｈ Ｃｒｏｐ Ｐｒｏｔｅｃｔｉｏｎ Ｃｏｕｎｃｉｌ ２００９から公知である。
【０１２３】
式（Ｉ）の化合物は、未変性の形態で使用され得るか、又は、好ましくは、配合物の当該技術分野において従来採用されている補助剤と一緒に使用され得る。この目的のために、これらは、公知の様式において、乳化性濃縮物、コーティング用ペースト、直接噴射可能若しくは希釈可能な溶液又は懸濁液、希釈エマルジョン、水和剤、可溶性粉末、粉剤、粒質物及び例えば高分子物質中のカプセルに簡便に配合され得る。組成物のタイプと同様に、吹付け、霧吹き、散粉、散布、コーティング又は掛け流しなどの施用方法は、意図される目的及びその時点での状況に応じて選択される。組成物は、安定化剤、消泡剤、粘度調節剤、バインダ又は粘着剤並びに肥料、微量元素の供給源又は特別な効果を得るための他の配合物などのさらなる補助剤も含有し得る。
【０１２４】
例えば、農業に用いられる好適なキャリア及び補助剤は、固体又は液体であり得、配合技術において有用な物質であり、例えば天然若しくは再生ミネラル物質、溶剤、分散剤、湿潤剤、粘着剤、増粘剤、バインダ又は肥料である。このようなキャリアは、例えば、国際公開第９７／３３８９０号に記載されている。
【０１２５】
式（Ｉ）の化合物は、通常、組成物の形態で用いられ、処理されるべき作物領域又は植物にさらなる化合物と同時に又は順次に適用され得る。これらのさらなる化合物は、例えば、肥料若しくは微量元素供与物又は植物の成長に影響を及ぼす他の調製物であり得る。これらは、選択的な除草剤若しくは非選択的な除草剤並びに殺虫剤、殺菌・殺カビ剤、殺菌剤、殺線虫剤、軟体動物駆除剤又はこれらの調製物の数種の混合物でもあり得、所望の場合には、配合物の当該技術分野において慣例的に利用されるさらなるキャリア、界面活性剤若しくは施用促進補助剤を伴う。
【０１２６】
式（Ｉ）の化合物は、組成物における唯一の有効成分であり得、また適切な場合、殺有害生物剤、殺菌・殺カビ剤、共力剤、除草剤又は植物成長調節剤などの１種以上の追加の有効成分と混合され得る。追加の有効成分は、いくつかの場合、予期しない相乗的活性をもたらし得る。
【０１２７】
通常、配合物は、０．０１～９０重量％の有効薬剤、０～２０％の農学的に許容可能な界面活性剤並びに１０～９９．９９％の固体又は液体不活性配合物及び補助剤を含み、有効薬剤は、コンポーネント（Ｂ）及び（Ｃ）並びに任意に他の有効薬剤、特に殺菌剤又は

防腐剤等を一緒に伴って少なくとも式（Ｉ）の化合物から構成される。組成物の濃縮形態は、一般に、約２～８０％、好ましくは約５～７０重量％の有効薬剤を含有する。配合物の適用形態は、例えば、０．０１～２０重量％、好ましくは０．０１～５重量％の有効薬剤を含有し得る。市販製品は、濃縮物として配合されていることが好ましいであろうが、エンドユーザーは、通常、希釈した配合物を利用することとなる。

【０１２８】

以下の表は、本発明に係る式（Ｉ）：

【化８】



(I)

の個々の化合物の例を例示する。

【０１２９】

【表１】

表 1:本発明に係る式(I)の個別の化合物

Cpd No.	R^1	R^2	R^4	R^5
001	Et	(3-クロロ-4-ニトロ-フェニル)	[3-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]	Me
002	Et	(3-クロロ-4-ニトロ-フェニル)	(3-クロロピラゾール-1-イル)	Me
003	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	[3-(トリフルオロメトキシ)ピラゾール-1-イル]	Me
004	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	[4-クロロ-3-(トリフルオロメトキシ)ピラゾール-1-イル]	Me
005	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	[5-クロロ-3-(トリフルオロメトキシ)ピラゾール-1-イル]	Me
006	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	[3-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]	H
007	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	(3-クロロピラゾール-1-イル)	H
008	Et	(3-クロロ-4-ニトロ-フェニル)	[3-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]	H
009	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	(3,5-ジクロロピラゾール-1-イル)	Me
010	Et	(3-クロロ-4-ニトロ-フェニル)	(3,5-ジクロロピラゾール-1-イル)	Me
011	Me	(3,4-ジクロロフェニル)	[3-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]	Me
012	n-プロピル	(3,4-ジクロロフェニル)	[3-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]	Me
013	アリル	(3,4-ジクロロフェニル)	[3-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]	Me
014	2-メトキシエチル	(3,4-ジクロロフェニル)	[3-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]	Me
015	メトキシ	(3,4-ジクロロフェニル)	[3-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]	Me
016	プロパ-2-イニル	(3,4-ジクロロフェニル)	[3-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]	Me
017	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	[3-(ジフルオロメトキシ)ピラゾール-1-イル]	Me
018	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	[3-(トリフルオロメトキシ)ピラゾール-1-イル]	Me
019	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	[4-(ジフルオロメトキシ)ピラゾール-1-イル]	Me
020	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	[4-(トリフルオロメトキシ)ピラゾール-1-イル]	Me
021	Et	(3,4-ジフルオロフェニル)	[4-(ジフルオロメトキシ)ピラゾール-1-イル]	Me
022	Et	(3,4-ジフルオロフェニル)	[4-(トリフルオロメトキシ)ピラゾール-1-イル]	Me
023	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	(3-メトキシ-1,2,4-トリアゾール-1-イル)	Me
024	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	[3-(トリフルオロメトキシ)-1,2,4-トリアゾール-1-イル]	Me

Cpd No.	R^1	R^2	R^4	R^5
025	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	[3-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]	H
026	Et	(3,4-ジクロロフェニル)	(3-クロロピラゾール-1-イル)	H

【０１３０】

表Ａ－１は、式（Ｉ）の２６種の化合物Ａ－１．００１～Ａ．１．０２６を提供するものであり、ここで、R^1、R^2、R^4、及びR^5は、表１に定義されているとおりである。

【０１３１】
配合例
【０１３２】
【表２】

水和剤	a)	b)	c)
有効成分[式(I)の化合物]	25％	50％	75％
リグノスルホン酸ナトリウム	5％	5％	－
ラウリル硫酸ナトリウム	3％	－	5％
ジイソブチルナフタレンスルホン酸ナトリウム	－	6％	10％
フェノールポリエチレングリコールエーテル (7～8 molのエチレンオキシド)	－	2％	－
高分散ケイ酸	5％	10％	10％
カオリン	62％	27％	－

【０１３３】
有効成分を補助剤と十分に混合し、この混合物を好適なミルで十分に粉砕して、水で希釈して所望の濃度の懸濁液を得ることが可能である水和剤が得られる。
【０１３４】
【表３】

乾燥種子処理に係る粉末	a)	b)	c)
有効成分[式(I)の化合物]	25％	50％	75％
軽質鉱油	5％	5％	5％
高分散ケイ酸	5％	5％	－
カオリン	65％	40％	－
タルカム	－		20％

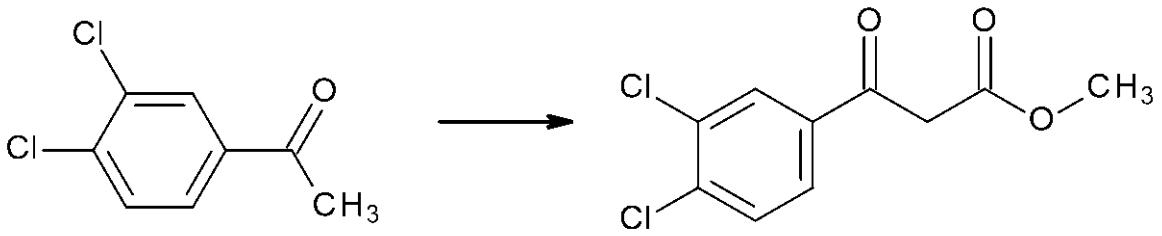
【０１３５】
有効成分を補助剤と十分に混合し、この混合物を好適なミルで十分に粉砕して、種子処理にそのまま使用可能である粉末が得られる。
【０１３６】
乳化性濃縮物
有効成分［式（Ｉ）の化合物］　１０％
オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル　３％
（４～５ｍｏｌのエチレンオキシド）
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム　３％
ヒマシ油ポリグリコールエーテル（３５ｍｏｌのエチレンオキシド）　４％
シクロヘキサノン　３０％
キシレン混合物　５０％
【０１３７】
植物の保護に用いることが可能であるいずれかの要求される希釈率のエマルジョンは、この濃縮物から水による希釈で得ることが可能である。
【０１３８】

【表４】

粉剤	a)	b)	c)
有効成分[式(I)の化合物]	5％	6％	4％
タルカム	95％	－	－
カオリン	－	94％	－
無機充填材	－	－	96％

【０１３９】
すぐに使用可能な粉剤は、有効成分をキャリアと混合し、この混合物を好適なミルで粉砕することにより得られる。このような粉末はまた、種子の乾燥粉衣に用いることが可能である。
【０１４０】
押出し顆粒
有効成分［式（Ｉ）の化合物］　１５％
リグノスルホン酸ナトリウム　２％
カルボキシメチルセルロース　１％
カオリン　８２％
【０１４１】
有効成分を混合し、補助剤と共に粉砕し、この混合物を水で湿らせる。混合物を押し出し、次いで、空気流中で乾燥させる。
【０１４２】
被覆顆粒
有効成分［式（Ｉ）の化合物］　８％
ポリエチレングリコール（ｍｏｌ．ｗｔ．２００）　３％
カオリン　８９％
【０１４３】
細かく粉砕した有効成分を、ポリエチレングリコールで湿らせたカオリンにミキサ中で均一に適用する。粉塵を発生させない被覆顆粒がこれにより得られる。
【０１４４】
懸濁液濃縮物
有効成分［式（Ｉ）の化合物］　４０％
プロピレングリコール　１０％
ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル（１５ｍｏｌのエチレンオキシド）　６％
リグノスルホン酸ナトリウム　１０％
カルボキシメチルセルロース　１％
シリコーン油（７５％水中エマルジョンの形態）　１％
水　３２％
【０１４５】
細かく粉砕した有効成分を補助剤と完全に混合して懸濁液濃縮物を得、これから、いずれかの所望の希釈率を有する懸濁液を水による希釈によって得ることが可能である。このような希釈により、生存している植物、並びに、植物繁殖材料を、吹付け、注ぎかけ、又は、浸漬により処理し、微生物による外寄生から保護することが可能である。
【０１４６】
種子処理用フロアブル剤濃縮物
有効成分［式（Ｉ）の化合物］　４０％
プロピレングリコール　５％
コポリマーブタノールＰＯ／ＥＯ　２％
トリスチレンフェノール＋１０～２０モルのＥＯ　２％

１，２－ベンズイソチアゾリン－３－オン（２０％水溶液の形態）　０．５％
モノアゾ顔料カルシウム塩　５％
シリコーン油（７５％水中エマルジョンの形態）　０．２％
水　４５．３％
【０１４７】
細かく粉砕した有効成分を補助剤と完全に混合して懸濁液濃縮物を得、これから、いずれかの所望の希釈率を有する懸濁液を水による希釈によって得ることが可能である。このような希釈を使用することにより、生存している植物、並びに、植物繁殖材料を、吹付け、注ぎかけ、又は、浸漬により処理し、微生物による外寄生から保護することが可能である。
【０１４８】
緩効性カプセル懸濁液
２８部の式（Ｉ）の化合物の組み合わせを、２部の芳香族溶剤及び７部のトルエンジイソシアネート／ポリメチレン－ポリフェニルイソシアネート混合物（８：１）と混合する。この混合物を、１．２部のポリビニルアルコール、０．０５部の脱泡剤及び５１．６部の水の混合物中に、所望の粒径が達成されるまで乳化させる。このエマルジョンに、５．３部の水中の２．８部の１，６－ジアミノヘキサンの混合物を添加する。混合物を重合反応が完了するまで撹拌する。得られるカプセル懸濁液を、０．２５部の増粘剤及び３部の分散剤を添加することにより安定化させる。このカプセル懸濁液配合物は、２８％の有効成分を含有する。中程度のカプセル径は８～１５ミクロンである。得られた配合物は、この目的のために好適な装置で水性懸濁液として種子に適用される。
【実施例】
【０１４９】
以下の非限定的な実施例は、以下の表２において参照される代表的な本発明の化合物の特定の合成方法を提供する。
【０１５０】
略語のリスト
Å＝オングストローム、ｂｒｓ＝幅広い一重項、℃＝摂氏度、ｄ＝二重項、ｄｄ＝二重項の二重項、ＤＭＳＯ＝ジメチルスルホキシド、ＨＰＬＣ＝高速液体クロマトグラフィ、Ｍ＝モル量、ｍ＝多重項、ＭＨｚ＝メガヘルツ、ｍＬ＝ミリリットル、ｑ＝四重項、ｓ＝一重項、ｔ＝三重項、ＴＨＦ＝テトラヒドロフラン。
【０１５１】
実施例１：２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－６－メチル－４－オキソ－５－［３－（トリフルオロメチル）ピラゾール－１－イル］ピリジン－３－カルボン酸（化合物１）の合成
ステップ１：メチル３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－オキソ－プロパノエートの合成
【化９】



窒素雰囲気下で、０℃に冷却した１－（３，４－ジクロロフェニル）エタノン（５．００ｇ、２６．５ｍｍｏｌ）及びジメチルカーボネート（４０ｍＬ、４６６ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、水素化ナトリウム（３．１７ｇ、７９．５ｍｍｏｌ、６０質量％）を数回に分けて添加した。反応混合物を室温に温め、１６時間撹拌した。一晩で、反応混合物は固体

のペーストとなり撹拌は不可能であった。試みとしてジメチルカーボネート（１０ｍＬ）をさらに添加して失活のために流動性のスラリーを形成した。反応混合物を０℃に冷却し、窒素雰囲気下に水（２５ｍＬ）を添加して失活させた。水性塩酸（２Ｍ）の添加により、反応混合物をｐＨ３に酸性化し、次いで、酢酸エチルで抽出した。有機抽出物を硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下で乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、溶離液として０～１５％のイソヘキサン中の酢酸エチルの勾配を用いるシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、メチル３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－オキソ－プロパノエート（互変異性体の混合物）を無色の液体として得た。

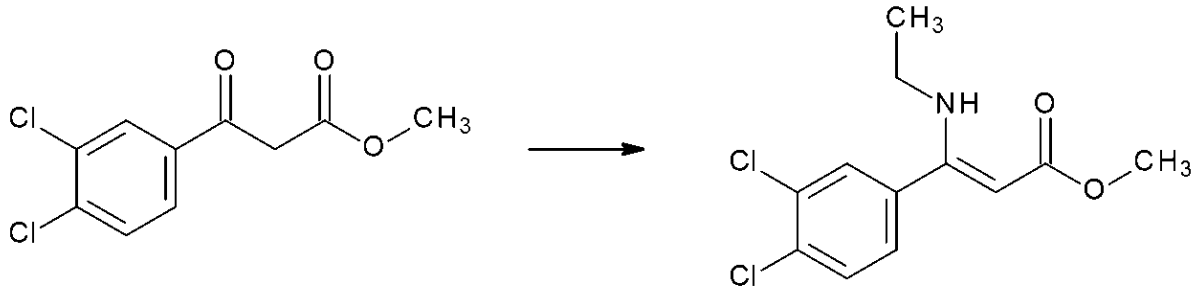
エノール：^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝１２．４７（ｓ，１Ｈ），７．８７（ｄ，１Ｈ），７．５９（ｍ，３Ｈ），７．４９（ｄ，１Ｈ），５．６５（ｓ，１Ｈ），３．８２（ｓ，３Ｈ）

ケト：^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝８．０３（ｄ，１Ｈ），７．７７（ｍ，１Ｈ），７．５８（ｄ，２Ｈ），３．９７（ｓ，２Ｈ），３．７６（ｓ，３Ｈ）．

【０１５２】

ステップ２：メチル（Ｚ）－３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－（エチルアミノ）プロパ－２－エノエートの合成

【化１０】

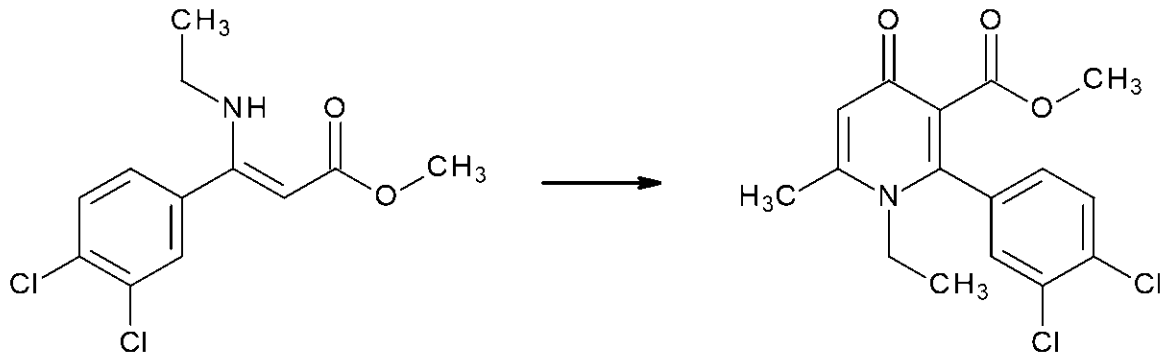


０℃でのエチルアミンの撹拌溶液（ＴＨＦ中２Ｍ）（１２．２ｍＬ、２４．３４ｍｍｏｌ）に、酢酸（１．３９ｍＬ、２４．３ｍｍｏｌ）を滴下した。混合物を室温に温め、１時間撹拌し、その後減圧下で蒸発乾固して酢酸エチルアンモニウム（２．５５ｇ、２４．３ｍｍｏｌ）を得た。トルエン（２０ｍＬ）中のメチル　３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－オキソ－プロパノエート（２．００ｇ、８．０９ｍｍｏｌ）の溶液に、酢酸エチルアンモニウム（２．５５ｇ、２４．３ｍｍｏｌ）を添加し、これに、酢酸（０．４６ｍＬ、８．０９ｍｍｏｌ）及び粉状の４Åモレキュラーシーブの添加が続いた。反応混合物を還流で１８時間加熱した。冷却した反応混合物を酢酸エチルで希釈し、ろ過し、飽和重炭酸ナトリウム水溶液で洗浄した。相を分離し、水性相を酢酸エチル（３回）で抽出した。合わせた有機抽出物を塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下で蒸発乾固した。粗残渣を、溶離液として０～１０％のイソヘキサン中の酢酸エチルの勾配を用いるシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、メチル（Ｚ）－３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－（エチルアミノ）プロパ－２－エノエートを淡黄色の油として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝８．３７（ｂｒ　ｓ，１Ｈ），７．４８（ｄ，１Ｈ），７．４６（ｄ，１Ｈ），７．２０（ｍ，１Ｈ），４．５５（ｓ，１Ｈ），３．６８（ｓ，３Ｈ），３．０７（ｍ，２Ｈ），１．１３－１．０９（ｍ，３Ｈ）．

【０１５３】

ステップ３：メチル　２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートの合成

【化１１】

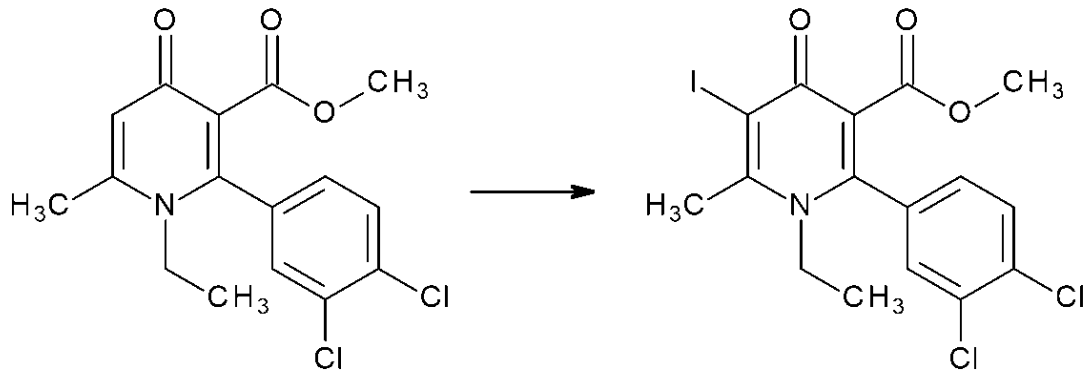


窒素下のメチル（Ｚ）－３－（３，４－ジクロロフェニル）－３－（エチルアミノ）プロパ－２－エノエート（１．５０ｇ、５．５ｍｍｏｌ）と２，２，６－トリメチル－１，３－ジオキシン－４－オン（０．８２ｇ、５．５ｍｍｏｌ）との撹拌混合物を１２０℃で３時間加熱した。冷却した反応混合物を減圧下で蒸発乾固した。粗残渣を、溶離液として０～１０％のジクロロメタン中のメタノールの勾配を用いるシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、メチル　２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートをオフホワイトの固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．５６（ｄ，１Ｈ），７．５０（ｄ，１Ｈ），７．２４（ｍ，１Ｈ），６．４１（ｓ，１Ｈ），３．７２（ｑ，２Ｈ），３．５５（ｓ，３Ｈ），２．４２（ｓ，３Ｈ），１．１３（ｔ，３Ｈ）．

【０１５４】

ステップ４：メチル　２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－５－ヨード－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートの合成

【化１２】



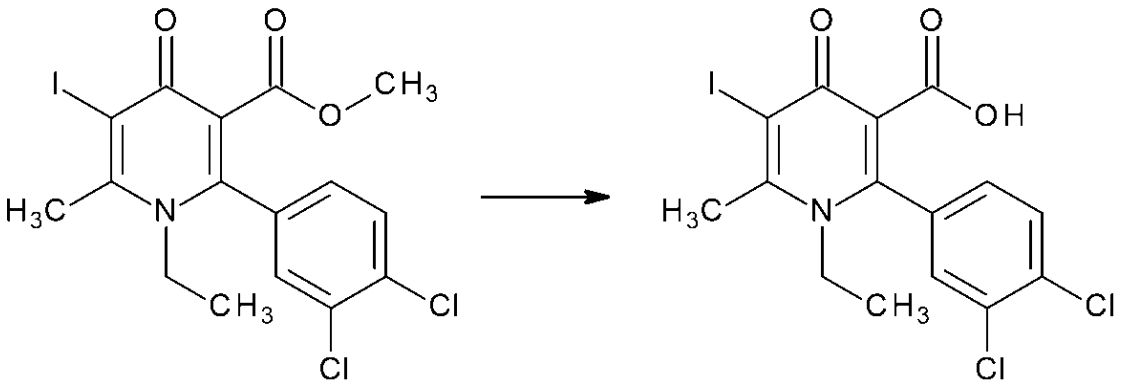
室温での及び窒素下のアセトニトリル（５６．０ｍＬ）中のメチル　２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレート（５．６０ｇ、１６．５ｍｍｏｌ）の溶液に、１－ヨードピロリジン－２，５－ジオン（３．７０ｇ、１６．５ｍｍｏｌ）、引き続き２，２，２－トリフルオロ酢酸（０．５６４ｇ、０．３８１ｍＬ、４．９４ｍｍｏｌ）を添加した。反応混合物を８０℃で３６時間加熱し、次いで室温で４８時間撹拌した。冷却した反応混合物を、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液（２００ｍＬ）の添加により失活させ、ジクロロメタン（３回）で抽出した。合わせた有機抽出物を、飽和チオ硫酸ナトリウム溶液、次いで塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で蒸発させた。粗残渣を、溶離液として０～１００％のシクロヘキサン中の酢酸エチルの勾配を用いるシリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィにより精製して、メチル　２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－５－ヨード－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレートを白色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．５７（ｄ，１Ｈ），７．

４９（ｄ，１Ｈ），７．２３（ｍ，１Ｈ），３．８９（ｑ，２Ｈ），３．５７（ｓ，３Ｈ），２．８８（ｓ，３Ｈ），１．１７（ｔ，３Ｈ）．

【０１５５】

ステップ５：２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－５－ヨード－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸の合成

【化１３】

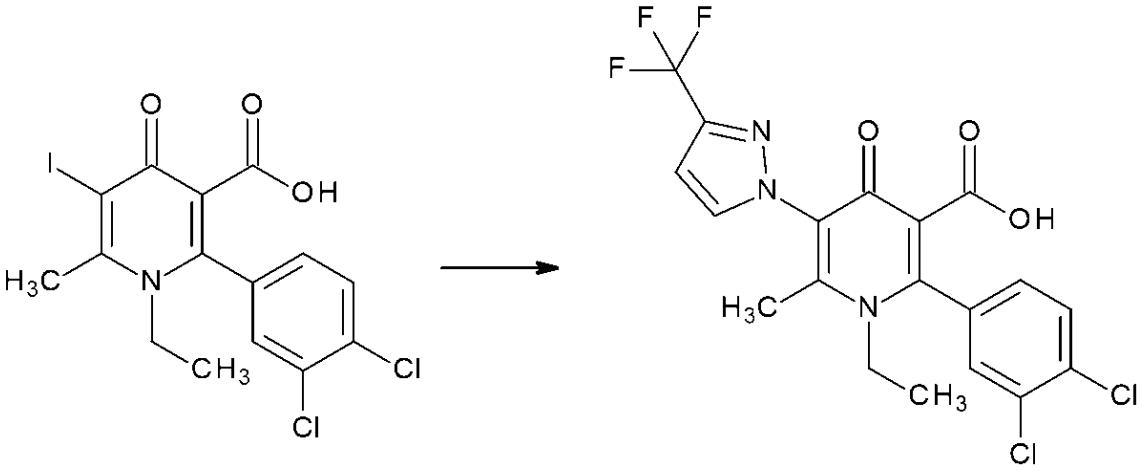


メタノール（１１３ｍＬ）中のメチル　２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－５－ヨード－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボキシレート（１２．６０ｇ、２７．０ｍｍｏｌ）の溶液に、水（３１．５ｍＬ）中の水酸化リチウム（２．５９ｇ、１０８ｍｍｏｌ）の溶液を添加した。得られた白色の懸濁液を８０℃で２時間加熱し、次いで室温で１８時間そのままにした。冷却した反応混合物を、塩化水素水溶液（２Ｍ）の添加によりｐＨ　１に酸性化した。得られた白色の沈殿物をろ過により集め、水で洗浄し、風乾させて、２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－５－ヨード－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸を白色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（５００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝１６．０６（ｂｒｓ，１Ｈ），７．６０（ｄ，１Ｈ），７．３４（ｄ，１Ｈ），７．１０（ｄｄ，１Ｈ），４．０４－３．９９（ｍ，２Ｈ），２．９９（ｓ，３Ｈ），１．２３（ｔ，３Ｈ）

【０１５６】

ステップ６：２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－６－メチル－４－オキソ－５－［３－（トリフルオロメチル）ピラゾール－１－イル］ピリジン－３－カルボン酸の合成

【化１４】



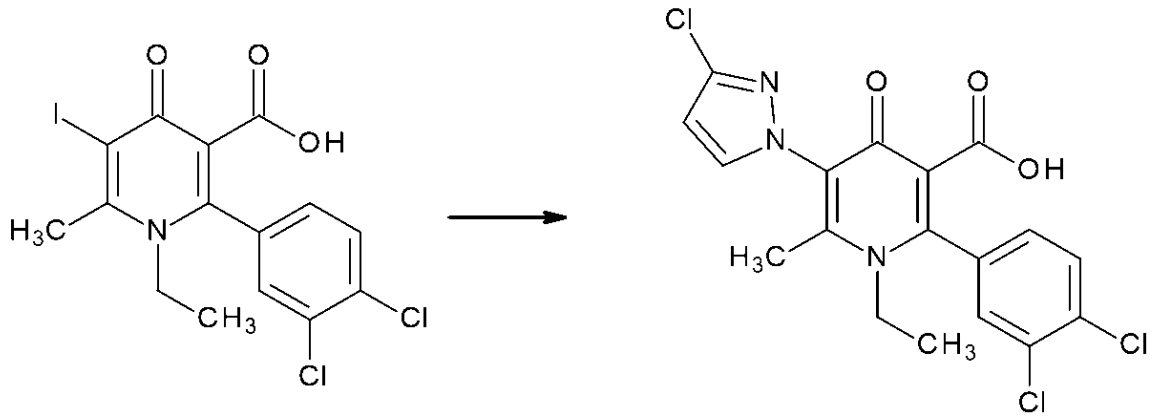
２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－５－ヨード－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸（０．２５ｇ、０．５５３ｍｍｏｌ）、３－（トリフルオ

ロメチル）－１Ｈ－ピラゾール（０．２７ｇ、１．９９ｍｍｏｌ）、ヨウ化銅（Ｉ）（０．１０６ｇ、０．５５３ｍｍｏｌ）、Ｎ，Ｎ’－ビス（２，６－ジメトキシフェニル）オキサミド（０．３９９ｇ、１．１１ｍｍｏｌ）及び炭酸カリウム（０．２３２ｇ、１．６６ｍｍｏｌ）の混合物を、窒素（３回）でパージし、その後ジメチルスルホキシド（３．７５ｍＬ）を添加した。反応混合物を撹拌しながら１２０℃で１８時間加熱した。冷却した反応混合物を水に注ぎ込み、ジエチルエーテルで希釈した。水性相を、塩化水素水溶液（２Ｍ）の添加によりｐＨ　１に酸性化した。茶色の固体沈殿物をろ過により除去し、有機相を塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で蒸発乾固した。粗残渣を質量分析逆相ＨＰＬＣにより精製して、２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－６－メチル－４－オキソ－５－［３－（トリフルオロメチル）ピラゾール－１－イル］ピリジン－３－カルボン酸を白色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．８５－７．８０（ｍ，１Ｈ），７．６２（ｄ，１Ｈ），７．３８（ｄ，１Ｈ），７．１３（ｄｄ，１Ｈ），６．７９（ｄ，１Ｈ），３．９５（ｑ，２Ｈ），２．４１（ｓ，３Ｈ），１．２７（ｔ，３Ｈ）．

【０１５７】

実施例２：５－（３－クロロピラゾール－１－イル）－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸（化合物２）の合成

【化１５】



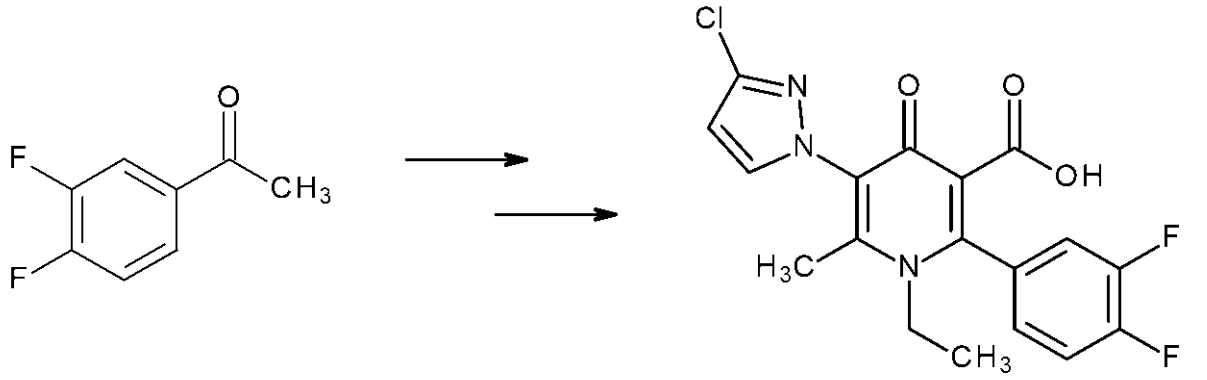
２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－５－ヨード－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸（０．２５０ｇ、０．５５３ｍｍｏｌ）、３－クロロ－１Ｈ－ピラゾール（０．２０４ｇ、１．９９ｍｍｏｌ）、ヨウ化銅（Ｉ）（０．１０６ｇ、０．５５３ｍｍｏｌ）、Ｎ，Ｎ’－ビス（２，６－ジメトキシフェニル）オキサミド（０．３９９ｇ、１．１１ｍｍｏｌ）及び炭酸カリウム（０．２３２ｇ、１．６６ｍｍｏｌ）の混合物を、窒素（３回）でパージし、その後ＤＭＳＯ（３．７５ｍＬ）を添加した。反応混合物を１２０℃で１８時間加熱した。冷却した反応混合物を水に注ぎ込み、ジエチルエーテルで希釈した。水性相を、塩化水素水溶液（２Ｍ）の添加によりｐＨ　１に酸性化した。茶色の固体沈殿物をろ過により除去し、有機相を塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で蒸発乾固した。粗残渣を質量分析逆相ＨＰＬＣにより精製して、５－（３－クロロピラゾール－１－イル）－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸を白色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．６７（ｄ，１Ｈ），７．６２（ｄ，１Ｈ），７．３７（ｄ，１Ｈ），７．１３（ｄｄ，１Ｈ），６．４７（ｄ，１Ｈ），３．９５（ｑ，２Ｈ），２．４７（ｓ，３Ｈ），１．２６（ｔ，３Ｈ）．

【０１５８】

実施例３：５－（３－クロロピラゾール－１－イル）－２－（３，４－ジフルオロフェニル）－１－エチル－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸（化合物４）の

合成

【化１６】



５－（３－クロロピラゾール－１－イル）－２－（３，４－ジフルオロフェニル）－１－エチル－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸を、本明細書で記載される６ステップ手順に従って３’，４’－ジフルオロアセトフェノンから５－（３－クロロピラゾール－１－イル）－２－（３，４－ジクロロフェニル）－１－エチル－６－メチル－４－オキソ－ピリジン－３－カルボン酸についてのように調製した。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，クロロホルム）δ＝７．６８（ｄ，１Ｈ），７．３５（ｔｄ，１Ｈ），７．１３（ｄｄｄ，１Ｈ），７．０４－６．９８（ｍ，１Ｈ），６．４７（ｄ，１Ｈ），３．９６（ｑ，２Ｈ），２．４７（ｓ，３Ｈ），１．２６（ｔ，３Ｈ）

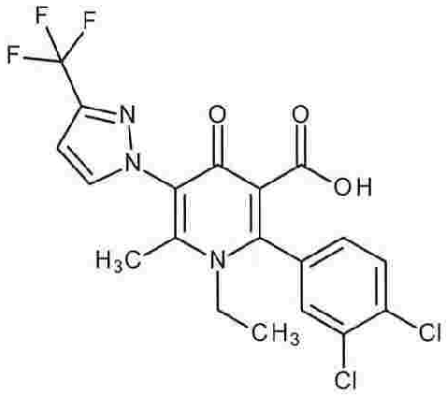
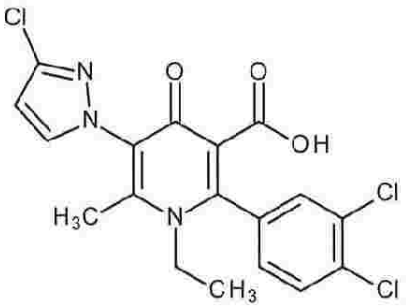
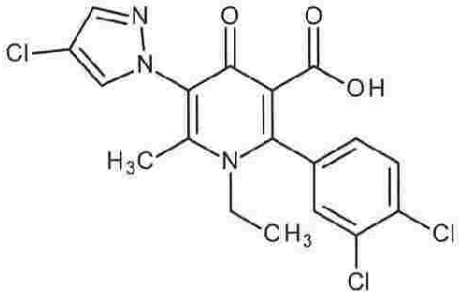
【０１５９】

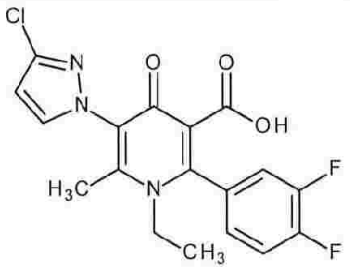
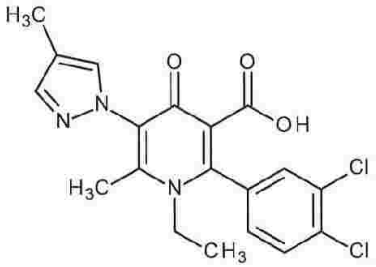
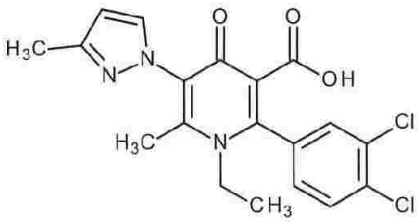
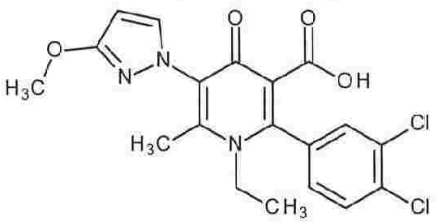
この記載の全体にわたって、温度は摂氏度（℃）で示し、「ｍ．ｐ．」は融点を意味する。

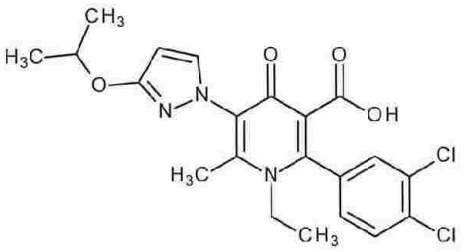
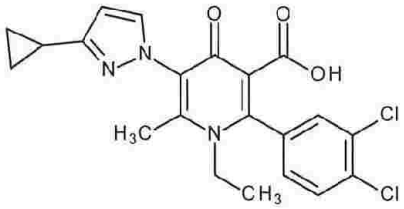
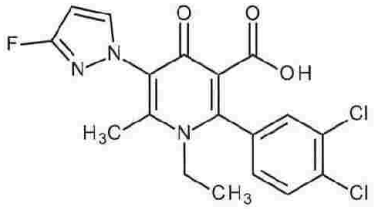
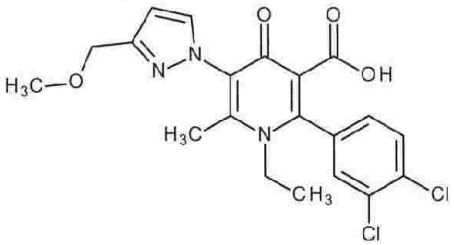
【０１６０】

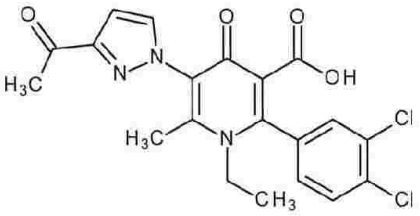
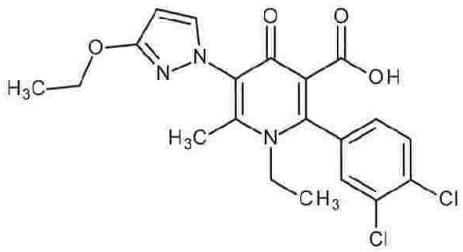
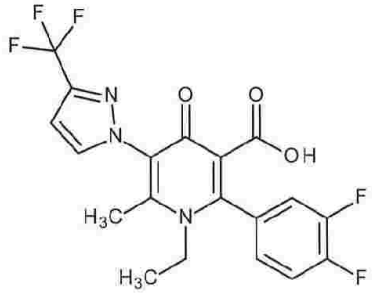
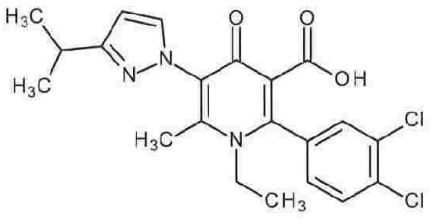
【表５】

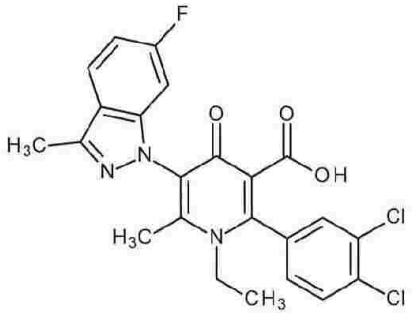
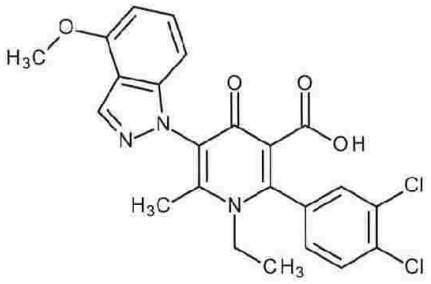
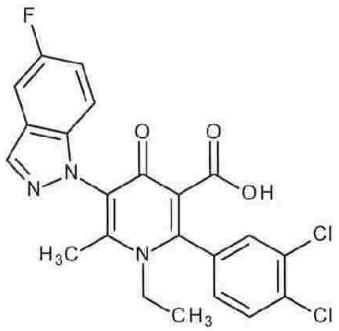
表2:本発明に係る選択された化合物の^{1}H NMRデータ

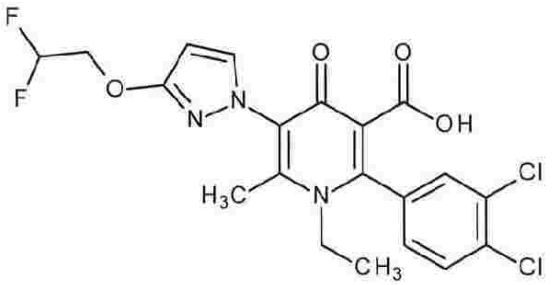
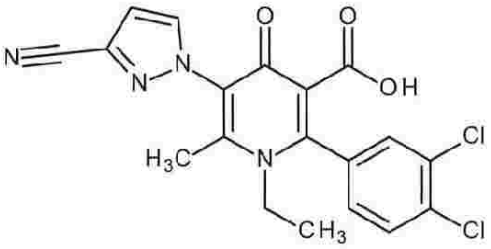
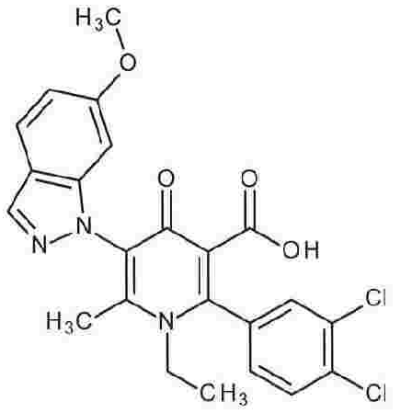
化合物 No.	化合物名	構造 & ^{1}H NMRデータ
1	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-メチル-4-オキソ-5-[3-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.85 – 7.80 (m, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 6.79 (d, 1H), 3.95 (q, 2H), 2.41 (s, 3H), 1.27 (t, 3H)
2	5-(3-クロロピラゾール-1-イル)-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.67 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 6.47 (d, 1H), 3.95 (q, 2H), 2.47 (s, 3H), 1.26 (t, 3H)
3	5-(4-クロロピラゾール-1-イル)-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (400 MHz, メタノール) δ = 7.88 (s, 1H), 7.77 – 7.69 (m, 3H), 7.44 (dd, 1H), 3.99 (q, 2H), 2.32 (s, 3H), 1.22 (t, 3H)

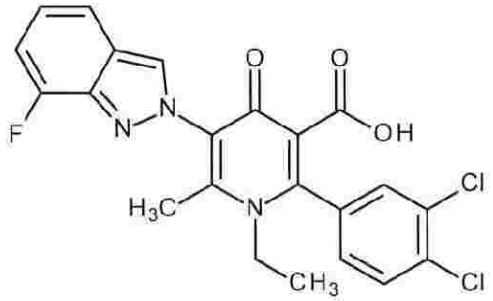
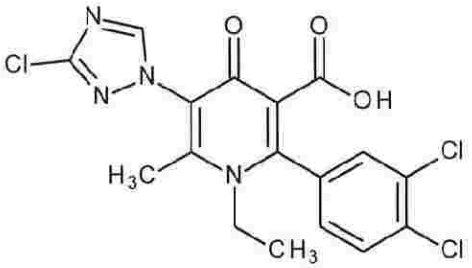
化合物 No.	化合物名	構造 & ^{1}H NMRデータ
4	5-(3-クロロピラゾール-1-イル)-2-(3,4-ジフルオロフェニル)-1-エチル-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.68 (d, 1H), 7.35 (td, 1H), 7.13 (ddd, 1H), 7.04 – 6.98 (m, 1H), 6.47 (d, 1H), 3.96 (q, 2H), 2.47 (s, 3H), 1.26 (t, 3H)
5	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-メチル-5-(4-メチルピラゾール-1-イル)-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.85 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.57 (d, 2H), 7.49 (dd, 1H), 3.88 (q, 2H), 2.24 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.11 (t, 3H)
6	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-メチル-5-(3-メチルピラゾール-1-イル)-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.48 (dd,1H), 6.30 (d, 1H), 3.88 (q, 2H), 2.27 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 1.12 (t, 3H)
7	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-5-(3-メトキシピラゾール-1-イル)-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.47 (dd, 1H), 5.96 (d, 1H), 3.88 (q, 2H), 3.81 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 1.12 (t, 3H)

化合物No.	化合物名	構造 & ^{1}H NMRデータ
8	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-5-(3-イソプロポキシピラゾール-1-イル)-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.48 (dd, 1H), 5.91 (d, 1H), 4.73 - 4.68 (m, 1H), 3.87 (q, 2H), 2.32 (s, 3H), 1.30 (d, 6H), 1.16 - 1.07 (m, 3H)
9	5-(3-シクロプロピルピラゾール-1-イル)-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.47 (dd, 1H), 6.21 (d, 1H), 3.87 (q, 2H), 2.25 (s, 3H), 1.97 - 1.92 (m, 1H), 1.11 (t, 3H), 0.97 - 0.87 (m, 2H), 0.73 - 0.67 (m, 2H)
10	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-5-(3-フルオロピラゾール-1-イル)-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.84 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.76 (t, 1H), 7.48 (dd, 1H), 6.27 (dd, 1H), 3.95 - 3.79 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 1.11 (t, 3H)
11	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-5-[3-(メトキシメチル)ピラゾール-1-イル]-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.84 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.79 - 7.76 (m, 1H), 7.48 (dd, 1H), 6.49 (d, 1H), 4.43 (s, 2H), 3.88 (q, 2H), 3.29 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 1.12 (t, 3H)

化合物No.	化合物名	構造 & ^{1}H NMRデータ
12	5-(3-アセチルピラゾール-1-イル)-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.95 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.50 (dd, 1H), 6.94 (d, 1H), 3.89 (q, 2H), 2.53 - 2.51 (m, 3H), 2.26 (s, 3H), 1.13 (t, 3H)
13	2-(3,4-ジクロロフェニル)-5-(3-エトキシピラゾール-1-イル)-1-エチル-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.47 (dd, 1H), 5.94 (d, 1H), 4.14 (q, 2H), 3.87 (q, 2H), 2.32 (s, 3H), 1.32 (t, 3H), 1.11 (t, 3H)
14	2-(3,4-ジフルオロフェニル)-1-エチル-6-メチル-4-オキソ-5-[3-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 7.81 (s, 1H), 7.36 (td, 1H), 7.13 (ddd, 1H), 7.01 (ddd, 1H), 6.80 (d, 1H), 3.97 (q, 2H), 2.43 (s, 3H), 1.28 (t, 3H)
15	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-5-(3-イソプロピルピラゾール-1-イル)-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.48 (dd, 1H), 6.35 (d, 1H), 3.88 (q, 2H), 3.00 - 2.93 (m, 1H), 2.25 (s, 3H), 1.25 (d, 6H),

化合物No.	化合物名	構造 & ^{1}H NMRデータ
		1.18 – 1.06 (m, 3H)
16	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-5-(6-フルオロ-3-メチル-インダゾール-1-イル)-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.92 – 7.82 (m, 2.5H), 7.77 (d, 0.5H), 7.57 (dd, 0.5H), 7.45 (dd, 0.5H), 7.15 – 7.04 (m, 1.5H), 7.01 (dd, 0.5H), 3.98 – 3.86 (m, 2H), 2.57 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 1.16 (t, 3H)
17	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-5-(4-メトキシインダゾール-1-イル)-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.34 (s, 1H), 7.92 (d, 0.5H), 7.87 – 7.82 (m, 1.5H), 7.58 (dd, 0.5H), 7.52 (dd, 0.5H), 7.35 (dt, 1H), 6.84 (d, 0.5H), 6.80 (d, 0.5H), 6.70 (d, 1H), 3.98 (s, 3H), 3.92 (q, 2H), 2.20 (s, 3H), 1.15 (t, 3H)
18	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-5-(5-フルオロインダゾール-1-イル)-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.38 (s, 1H), 7.93 (d, 0.5H), 7.87 – 7.81 (m, 1.5H), 7.70 – 7.65 (m, 1H), 7.58 (dd, 0.5H), 7.50 (dd, 0.5H), 7.38 – 7.32 (m, 1.5H), 7.29 – 7.27 (m, 0.5H), 3.92 (q, 2H), 2.23 (s, 3H), 1.16 (t, 3H)

化合物No.	化合物名	構造 & ^{1}H NMRデータ
19	2-(3,4-ジクロロフェニル)-5-[3-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピラゾール-1-イル]-1-エチル-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 7.83 (d, 1H), 7.82 - 7.78 (m, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.48 (dd, 1H), 6.50 - 6.27 (m, 1H), 6.06 (d, 1H), 4.40 (dt, 2H), 3.87 (q, 2H), 2.32 (s, 3H), 1.12 (brt, 3H)
20	5-(3-シアノピラゾール-1-イル)-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.14 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.50 (dd, 1H), 7.24 (d, 1H), 3.87 (q, 2H), 2.23 (s, 3H), 1.12 (t, 3H)
21	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-5-(6-メトキシインダゾール-1-イル)-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.25 (s, 1H), 7.93 (d, 0.5H), 7.85 (d, 0.5H), 7.84 - 7.83 (m, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.58 (dd, 0.5H), 7.51 (dd, 0.5H), 6.89 (td, 1H), 6.70 (s, 0.5H), 6.64 (s, 0.5H), 3.96 - 3.92 (m, 2H), 3.79 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 1.17 (t, 3H)

化合物No.	化合物名	構造 & ^{1}H NMRデータ
22	2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-5-(7-フルオロインダゾール-2-イル)-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ = 8.61 (d, 1H), 7.89 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.53 (dd, 1H), 7.15 - 7.07 (m, 2H), 3.96 - 3.89 (m, 2H), 2.25 (s, 3H), 1.15 (t, 3H)
23	5-(3-クロロ-1,2,4-トリアゾール-1-イル)-2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル-6-メチル-4-オキソ-ピリジン-3-カルボン酸	 ^{1}H NMR (400 MHz, クロロホルム) δ = 8.35 (s, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.14 (dd, 1H), 3.98 (q, 2H), 2.54 (s, 3H), 1.28 (t, 3H)

【０１６１】

生物学的実施例

多様なテスト種の種子をポット中の標準土壌に播種する（アメリカアサガオ（Ｉｐｏｍｏｅａ　ｈｅｄｅｒａｃｅａ）（ＩＰＯＨＥ）、アキノエノコログサ（Ｓｅｔａｒｉａ　ｆａｂｅｒｉ）（ＳＥＴＦＡ）、トウモロコシ（Ｚｅａ　ｍａｙｓ）（ＺＥＡＭＸ）、イヌビエ（Ｅｃｈｉｎｏｃｈｌｏａ　ｃｒｕｓ－ｇａｌｌｉ）（ＥＣＨＣＧ）、オオホナガアオゲイトウ（Ａｍａｒａｎｔｈｕｓ　ｐａｌｍｅｒｉ）（ＡＭＡＰＡ）、アオゲイトウ（Ａｍａｒａｎｔｈｕｓ　ｒｅｔｏｆｌｅｘｕｓ）（ＡＭＡＲＥ））。制御された条件下に温室（２４℃／１６℃、昼／夜；１４時間の明かり；６５％湿度）で８日間栽培した後、０．５％Ｔｗｅｅｎ　２０（ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、ＣＡＳ　ＲＮ　９００５－６４－５）を含むアセトン／水（５０：５０）溶液中の工業用有効成分の配合物由来の水性噴霧溶液を植物に噴霧する。別段の定めがある場合を除き、化合物は、１０００ｇ／ｈａで適用する。次いで、制御された条件下に温室（２４℃／１６℃、昼／夜；１４時間の明かり；６５％湿度）中でテスト植物を育て、毎日２回給水した。１３日後、テストを、植物による損傷の割合について評価する。生物学的活性を５段階で以下の表に示す（５＝８１～１００％；４＝６１～８０％；３＝４１～６０％；２＝２１～４０％；１＝０～２０％、－＝未試験）。

【０１６２】

【表６】

表 B1:発芽前テスト

化合物 No.	IPOHE	SEFTA	ZEAMX	ECHCG	AMAPA	AMARE
1	4	1	0	0	0	0
2	4	3	1	0	–	–
3*	0	2	0	1	0	0

＊250g/Haでのデータ

【０１６３】

【表７】

表 B2:発芽後テスト

化合物 No.	IPOHE	SEFTA	ZEAMX	ECHCG	AMAPA	AMARE
1	2	1	1	1	3	2
2	4	4	3	4	–	–
3*	2	3	2	3	3	3

＊250g/Haでのデータ

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/064172

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. C07D401/04 A01N43/56 A01N43/653 A01P13/00
ADD.

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
EPO-Internal

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	US 4 451 282 A (KNOPS HANS-JOACHIM [DE] ET AL) 29 May 1984 (1984-05-29) the whole document	1-15
A	GB 2 029 403 A (LILLY CO ELI) 19 March 1980 (1980-03-19) the whole document	1-15
A	EP 0 216 166 A1 (BAYER AG [DE]) 1 April 1987 (1987-04-01) the whole document	1-15
A	US 4 670 044 A (KNOPS HANS-JOACHIM [DE] ET AL) 2 June 1987 (1987-06-02) the whole document	1-15

-/--

[x] Further documents are listed in the continuation of Box C. [x] See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X" document of particular relevance;; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y" document of particular relevance;; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
19 June 2023	05/07/2023

Name and mailing address of the ISA/	Authorized officer
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Sarakinos, Georgios

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/064172

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	DE 32 10 598 A1 (BAYER AG [DE]) 6 October 1983 (1983-10-06) the whole document	1-15
A	WO 2021/009229 A1 (SYNGENTA CROP PROTECTION AG [CH]) 21 January 2021 (2021-01-21) the whole document	1-15
A	EP 0 040 082 A1 (ROHM & HAAS [US]) 18 November 1981 (1981-11-18) cited in the application the whole document	1-15
A	EP 0 239 391 A2 (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO [JP]; IHARA CHEMICAL IND CO [JP]) 30 September 1987 (1987-09-30) cited in the application the whole document	1-15

Form PCT/ISA/210 (continuation of second sheet) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2023/064172

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 4451282 A	29-05-1984	AT 17482 T	15-02-1986
		BR 8205206 A	16-08-1983
		CA 1196921 A	19-11-1985
		DK 395482 A	06-03-1983
		EP 0073999 A2	16-03-1983
		IL 66705 A	28-02-1986
		JP S5855481 A	01-04-1983
		US 4451282 A	29-05-1984
		ZA 826462 B	27-07-1983
GB 2029403 A	19-03-1980	AT 362613 B	10-06-1981
		BE 868393 A	27-12-1978
		BG 29870 A3	16-02-1981
		BG 30168 A4	15-04-1981
		BG 30175 A4	15-04-1981
		BG 30176 A4	15-04-1981
		CA 1075697 A	15-04-1980
		FR 2395996 A2	26-01-1979
		GB 2029403 A	19-03-1980
		GR 70237 B	01-09-1982
		GT 197852905 A	18-12-1979
		IN 149651 B	06-03-1982
		IT 1113145 B	20-01-1986
		LU 79873 A1	07-12-1978
		MW 1778 A1	09-05-1979
		RO 75145 A	30-01-1981
		RO 80037 A	26-10-1982
		RO 80699 A	06-12-1982
		ZA 783650 B	27-02-1980
		ZM 5878 A1	23-04-1979
EP 0216166 A1	01-04-1987	DE 3531773 A1	19-03-1987
		DK 425686 A	07-03-1987
		EP 0216166 A1	01-04-1987
		JP S6259262 A	14-03-1987
		ZA 866751 B	27-05-1987
US 4670044 A	02-06-1987	BR 8503881 A	27-05-1986
		DE 3430232 A1	27-02-1986
		EP 0171729 A1	19-02-1986
		JP S6163674 A	01-04-1986
		US 4670044 A	02-06-1987
DE 3210598 A1	06-10-1983	NONE	
WO 2021009229 A1	21-01-2021	AR 119397 A1	15-12-2021
		UY 38783 A	26-02-2021
		WO 2021009229 A1	21-01-2021
EP 0040082 A1	18-11-1981	AT 7195 T	15-05-1984
		AU 539399 B2	27-09-1984
		EG 15674 A	30-09-1986
		EP 0040082 A1	18-11-1981
		ES 8304404 A1	01-03-1983
		IL 62855 A	31-05-1984
		JP S6366314 B2	20-12-1988
		JP S57114573 A	16-07-1982
		NZ 197027 A	16-03-1984

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2023/064172

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
		ZA 813029 B	26-05-1982
EP 0239391 A2	30-09-1987	CA 1317599 C	11-05-1993
		DE 3789153 T2	07-07-1994
		EP 0239391 A2	30-09-1987
		JP H01163171 A	27-06-1989
		JP H07121911 B2	25-12-1995
		US 4757081 A	12-07-1988
		US 4871751 A	03-10-1989

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (April 2005)

フロントページの続き

,MC,ME,MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CV,CZ,DE,DJ,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IQ,IR,IS,IT,JM,JO,JP,KE,KG,KH,KN,KP,KR,KW,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,MG,MK,MN,MU,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SC,SD,SE,SG,SK,SL,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,WS,ZA,ZM,ZW

（特許庁注：以下のものは登録商標）

１．ＴＷＥＥＮ

(74)代理人　100232909
弁理士　佐藤 賢太
(72)発明者　モリス ジェームス アラン
イギリス アールジー４２　６イーワイ バークシャー ブラックネル シンジェンタ ジーロズ ヒル インターナショナル リサーチ センター シンジェンタ リミテッド内
(72)発明者　マーティン クリストファー ジェームス
イギリス アールジー４２　６イーワイ バークシャー ブラックネル シンジェンタ ジーロズ ヒル インターナショナル リサーチ センター シンジェンタ リミテッド内
(72)発明者　ウォーリー ルイーザ
イギリス アールジー４２　６イーワイ バークシャー ブラックネル シンジェンタ ジーロズ ヒル インターナショナル リサーチ センター シンジェンタ リミテッド内

Ｆターム（参考）　4H011　AB01 BB09 DA15 DE15