

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

(11)公表番号

特表2024-540946

(P2024-540946A)

(43)公表日 令和6年11月6日(2024.11.6)

(51)国際特許分類	F I	テーマコード(参考)
C 0 7 D 257/06 (2006.01)	C 0 7 D 257/06	A C S P 4 H 0 1 1
C 0 7 D 403/12 (2006.01)	C 0 7 D 403/12	
A 0 1 P 13/00 (2006.01)	A 0 1 P 13/00	
A 0 1 N 47/02 (2006.01)	A 0 1 N 47/02	
A 0 1 N 47/12 (2006.01)	A 0 1 N 47/12	1 0 2

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全27頁) 最終頁に続く

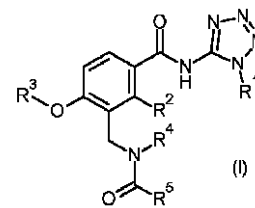
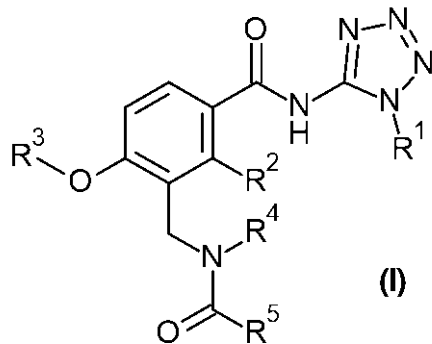
(21)出願番号	特願2024-523687(P2024-523687)	(71)出願人	520222106
(86)(22)出願日	令和4年10月13日(2022.10.13)		シンジェンタ クロップ プロテクション
(85)翻訳文提出日	令和6年4月19日(2024.4.19)		アクチエンゲゼルシャフト
(86)国際出願番号	PCT/EP2022/078501		スイス 4 0 5 8 パーゼル ローゼンタ
(87)国際公開番号	WO2023/066784		ールシュトラーセ 6 7
(87)国際公開日	令和5年4月27日(2023.4.27)	(74)代理人	100103610
(31)優先権主張番号	2115018.0		弁理士 吉 田 和彦
(32)優先日	令和3年10月20日(2021.10.20)	(74)代理人	100109070
(33)優先権主張国・地域又は機関			弁理士 須田 洋之
	英国(GB)	(74)代理人	100119013
(81)指定国・地域	AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA		弁理士 山崎 一夫
	,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(	(74)代理人	100111796
	AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,A		弁理士 服部 博信
	T,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR	(74)代理人	100123766
	,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC,		弁理士 松田 七重
	最終頁に続く		最終頁に続く

(54)【発明の名称】 除草剤としての置換ベンズアミド

(57)【要約】

本発明は、式(I)

【化1】



(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は、本明細書に記載されるとおりである)

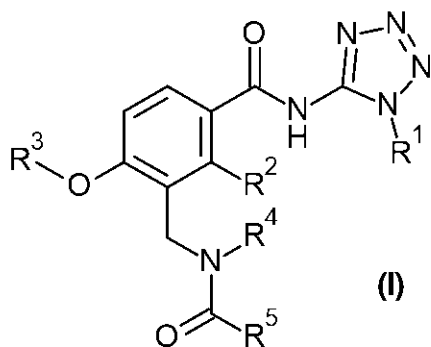
の化合物又はその農学的に許容可能な塩に関する。本発明は、前記化合物を含む組成物、前記組成物を使用して雑草を防除する方法及び除草剤としての式(I)の化合物の使用にさらに関する。

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

式 (I) :

## 【化 1】



10

(式中、

$R^1$ は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル -、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル -、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ -  $C_1 \sim C_4$ アルキル - 及び  $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ -  $C_1 \sim C_4$ アルキル - からなる群から選択され；

$R^2$ は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル -、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ -、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル -、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ - 及び -  $S(O)_p C_1 \sim C_6$ アルキル からなる群から選択され；

20

$R^3$ は、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルであり；

$R^4$ は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル -、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル及び  $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル からなる群から選択され；

$R^5$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ -  $C_1 \sim C_6$ アルキル -、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ -、フェニル及びヘテロアリアルからなる群から選択され、前記フェニル又はヘテロアリアルは、1、2又は3つの  $R^6$ 置換基によって任意に置換されていてもよく；

$R^6$ は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル - 及び  $C_1 \sim C_6$ アルコキシ - からなる群から独立して選択され；及び

30

$p$ は、0、1又は2である)

の化合物又はその農学的に許容可能な塩。

## 【請求項 2】

$R^1$ は、メチルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 3】

$R^2$ は、メチル、 $Cl$ 、 $-CF_3$ 及び  $-SO_2$ メチルからなる群から選択される、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

$R^2$ は、 $Cl$ である、請求項 3 に記載の化合物。

40

## 【請求項 5】

$R^3$ は、 $-CF_3$ 又は  $-CHF_2$ 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、水素又は  $C_1 \sim C_6$ アルキル - である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 7】

$R^5$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル - 又は  $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル - である、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 8】

$R^6$ は、 $-$ フェニルであり、前記  $-$ フェニルは、請求項 1 で定義されたとおりに任意に

50

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。

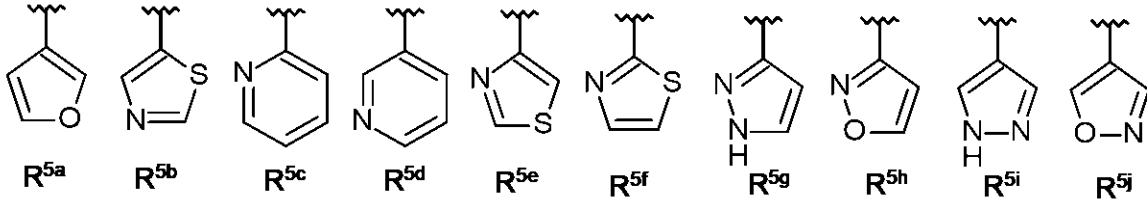
【請求項 9】

R<sup>5</sup>は、-ヘテロアリールであり、前記-ヘテロアリールは、請求項 1 で定義されたとおり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 10】

R<sup>5</sup>は、R<sup>5a</sup>、R<sup>5b</sup>、R<sup>5c</sup>、R<sup>5d</sup>、R<sup>5e</sup>、R<sup>5f</sup>、R<sup>5g</sup>、R<sup>5h</sup>、R<sup>5i</sup>及びR<sup>5j</sup>：

【化 2】



10

からなる群から選択されるヘテロアリールである、請求項 9 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と、農学的に許容可能な配合助剤とを含む除草性組成物。

【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 に記載の除草性組成物

20

【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 に記載の除草性組成物。

【請求項 14】

繁殖地において雑草を防除する方法であって、雑草防除量の、請求項 11 ~ 13 のいずれか一項に記載の組成物を前記繁殖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 に記載の式 (I) の化合物の使用。

【発明の詳細な説明】

30

【技術分野】

【0001】

本発明は、除草性化合物、その調製プロセス、化合物を含む除草性組成物及び特に有用な植物の作物における雑草の防除のため又は植物の成長の阻害のためのその使用に関する。

【背景技術】

【0002】

N-(テトラゾール-5-イル)アリールカルボキサミドは、例えば、国際公開第 2012/028579 号に開示されている。本発明は、意外なほど良好な雑草防除を示す新規アリールカルボキサミドに関する。

40

【発明の概要】

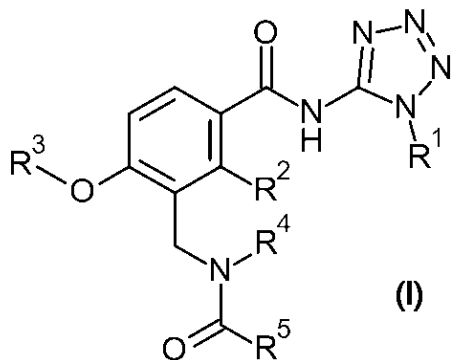
【課題を解決するための手段】

【0003】

従って、本発明によれば、式 (I) :

50

## 【化 1】



10

(式中、

$R^1$ は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル -、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル -、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ -  $C_1 \sim C_4$ アルキル - 及び  $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ -  $C_1 \sim C_4$ アルキル - からなる群から選択され；

$R^2$ は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル -、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ -、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル -、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ - 及び -  $S(O)_p C_1 \sim C_6$ アルキル からなる群から選択され；

$R^3$ は、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルであり；

20

$R^4$ は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル -、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル及び  $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル からなる群から選択され；

$R^5$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ -  $C_1 \sim C_6$ アルキル -、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ -、フェニル及びヘテロアリアルからなる群から選択され、フェニル又はヘテロアリアルは、1、2又は3つの  $R^6$ 置換基によって任意に置換されていてもよく；

$R^6$ は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル (例えば、メチル)、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル - 及び  $C_1 \sim C_6$ アルコキシ - からなる群から独立して選択され；及び

$p$ は、0、1又は2である)

の化合物又はその農学的に許容可能な塩が提供される。

30

## 【発明を実施するための形態】

## 【0004】

$C_1 \sim C_6$ アルキル基は、例えば、メチル (Me、 $CH_3$ )、エチル (Et、 $C_2H_5$ )、 $n$ -プロピル ( $n$ -Pr)、イソプロピル ( $i$ -Pr)、 $n$ -ブチル ( $n$ -Bu)、イソブチル ( $i$ -Bu)、 $sec$ -ブチル及び  $tert$ -ブチル ( $t$ -Bu) を含む。

## 【0005】

$C_3 \sim C_6$ シクロアルキル - は、シクロプロピル ( $c$ -プロピル ( $c$ -Pr))、シクロブチル ( $c$ -ブチル ( $c$ -Bu))、シクロペンチル ( $c$ -ペンチル) 及びシクロヘキシル ( $c$ -ヘキシル) を含む。

## 【0006】

$C_1 \sim C_3$ アルコキシ - 及び  $C_1 \sim C_6$ アルコキシは、例えば、メトキシ - 及びエトキシ - を含む。

40

## 【0007】

$C_1 \sim C_6$ -アルコキシ -  $C_1 \sim C_6$ アルキル - は、例えば、メトキシエチル - を含む。

## 【0008】

ハロゲン (又はハロ) は、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を包含する。同様のことは、対応して、ハロアルキルなど、他の定義に関連するハロゲンに当てはまる。

## 【0009】

$C_1 \sim C_6$ ハロアルキルとしては、例えば、フルオロメチル -、ジフルオロメチル -、トリフルオロメチル -、クロロメチル -、ジクロロメチル -、トリクロロメチル -、2、

50

2, 2 - トリフルオロエチル -、2, 2 - ジフルオロエチル、1, 1 - ジフルオロエチル、1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエチル、2 - フルオロエチル -、2 - クロロエチル -、ペンタフルオロエチル -、1, 1 - ジフルオロ - 2, 2, 2 - トリクロロエチル -、2, 2, 3, 3 - テトラフルオロエチル -、2, 2, 2 - トリクロロエチル -、ヘプタフルオロ - n - プロピル及びパーフルオロ - n - ヘキシルが挙げられる。C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキルとしては、例えば、フルオロメチル -、ジフルオロメチル -、トリフルオロメチル -、クロロメチル -、ジクロロメチル -、トリクロロメチル -、2, 2, 2 - トリフルオロエチル -、2 - フルオロエチル -、2 - クロロエチル -、ペンタフルオロエチル -、1, 1 - ジフルオロ - 2, 2, 2 - トリクロロエチル -、2, 2, 3, 3 - テトラフルオロエチル -、2, 2, 2 - トリクロロエチル - 及びヘプタフルオロ - n - プロピル - が挙げられる。

10

## 【0010】

C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルコキシ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル - は、例えば、メトキシエチル - を含む。

## 【0011】

C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルコキシ - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル - は、例えば、トリフルオロメトキシエチル - を含む。

## 【0012】

C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキル - S - (アルキルチオ) は、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、n - ブチルチオ、イソブチルチオ、sec - ブチルチオ又はtert - ブチルチオ、好ましくはメチルチオ又はエチルチオである。

20

## 【0013】

C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキル - S(O) - (アルキルスルフィニル) は、例えば、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル、n - ブチルスルフィニル、イソブチルスルフィニル、sec - ブチルスルフィニル又はtert - ブチルスルフィニル、好ましくはメチルスルフィニル又はエチルスルフィニルである。

## 【0014】

C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキル - S(O)<sub>2</sub> - (アルキルスルホニル) は、例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、n - ブチルスルホニル、イソブチルスルホニル、sec - ブチルスルホニル又はtert - ブチルスルホニル、好ましくはメチルスルホニル又はエチルスルホニルである。

30

## 【0015】

本発明の好ましい実施形態では、R<sup>1</sup>は、メチル、エチル及びn - プロピル、好ましくはメチルからなる群から選択される。

## 【0016】

本発明の好ましい実施形態では、R<sup>2</sup>は、メチル、C<sub>1</sub>、-CF<sub>3</sub>及び-SO<sub>2</sub>メチル、より好ましくはC<sub>1</sub>からなる群から選択される。

## 【0017】

本発明の他の好ましい実施形態では、R<sup>3</sup>は、-CF<sub>3</sub>又は-CHF<sub>2</sub>である。

## 【0018】

本発明の他の好ましい実施形態では、R<sup>4</sup>は、水素又はC<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキル - (好ましくはメチル)、最も好ましくはメチル又は水素である。

40

## 【0019】

本発明の他の実施形態では、R<sup>5</sup>は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキル - (例えば、メチル、エチル又はn - プロピル、好ましくはメチル) 又はC<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>シクロアルキル - (好ましくはcPr -) である。

## 【0020】

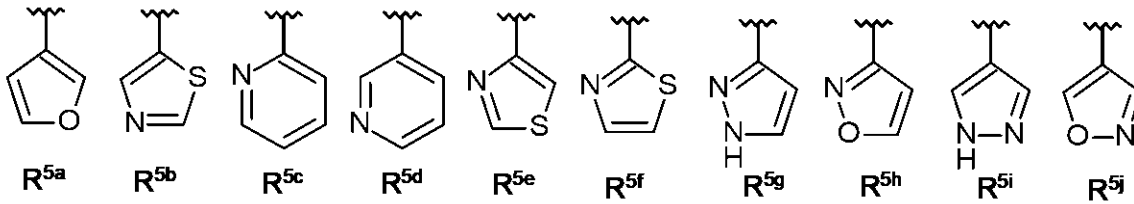
本発明の他の好ましい実施形態では、R<sup>5</sup>は、-フェニルであり、フェニルは、前述のとおり任意に置換されていてもよい。

## 【0021】

50

本発明の他の実施形態では、 $R^5$ は、ヘテロアリールであり、ヘテロアリールは、前述のとおり任意に置換されていてもよい。さらに好ましい実施形態では、ヘテロアリールは、5又は6員ヘテロアリールである。さらに好ましい実施形態では、ヘテロアリールは、 $R^{5a}$ 、 $R^{5b}$ 、 $R^{5c}$ 、 $R^{5d}$ 、 $R^{5e}$ 、 $R^{5f}$ 、 $R^{5g}$ 、 $R^{5h}$ 、 $R^{5i}$ 及び $R^{5j}$ ：

【化2】



10

からなる群から選択される。

【0022】

本発明の好ましい実施形態では、ヘテロアリールは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル（例えば、メチル）、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル及び $C_1 \sim C_6$ アルコキシからなる群から選択される1、2又は3つの置換基によって任意に置換されていてもよい $R^{5c}$ である。本発明のさらに好ましい実施形態では、ヘテロアリールは、1つのハロゲン、好ましくはフッ素によって任意に置換されていてもよい $R^{5c}$ である。

【0023】

20

本発明の一実施形態では、 $R^4$ は、水素又はメチルであり、及び $R^5$ は、メチル、エチル又はn-プロピルである。本発明の他の実施形態では、 $R^4$ は、水素又はメチルであり、及び $R^5$ は、フェニルであり、フェニルは、1つのハロゲン、好ましくはフッ素によって任意に置換されていてもよい。本発明の他の実施形態では、 $R^4$ は、水素又はメチルであり、及び $R^5$ は、ヘテロアリールであり、ヘテロアリールは、1つのハロゲン、好ましくはフッ素によって任意に置換されていてもよい $R^{5c}$ である。

【0024】

式(I)の化合物(及び式(I)の化合物を合成するために使用される特定の間mediate化合物)は、不斉中心を含み得、且つ単一の鏡像異性体として、いずれかの割合における鏡像異性体対として存在し得るか、又は2つ以上の不斉中心が存在する場合、あらゆる可能な比でジアステレオ異性体を含み得る。典型的には、鏡像異性体の1つは、他の可能なものと比べて高い生物学的活性を有する。

30

【0025】

本発明は、式(I)の化合物に係るすべての可能な幾何及び互変異形態も含む。

【0026】

本発明は、式(I)の化合物が、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)、アルカリ金属及びアルカリ土類金属塩基又は第四級アンモニウム塩基と形成し得る農学的に許容可能な塩も含む。塩形成物として用いられるアルカリ金属及びアルカリ土類金属水酸化物、酸化物、アルコキシド並びに炭酸水素塩及び炭酸塩のうち、リチウム、ナトリウム、カリウム、マグネシウム及びカルシウムの水酸化物、アルコキシド、酸化物及び炭酸塩、特にナトリウム、マグネシウム及びカルシウムの水酸化物、アルコキシド、酸化物及び炭酸塩が重要である。対応するトリメチルスルホニウム塩も用いられ得る。

40

【0027】

本発明による式(I)の化合物は、それ自体で除草剤として使用することができるが、それらは、一般に、担体、溶媒及び表面活性剤(SFA)などの製剤助剤を用いて除草性組成物に製剤化される。従って、本発明は、本発明による除草性化合物と、農学的に許容できる製剤助剤とを含む除草性組成物をさらに提供する。この組成物は、使用前に希釈される濃縮物の形態であり得るが、直ちに使用できる組成物も作製され得る。最終的な希釈は、通常、水を用いて行われるが、水の代わりに又は水に加えて、例えば液体肥料、微量

50

栄養素、生物有機体、油又は溶媒を用いて行われ得る。

【0028】

除草性組成物は、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%の製剤助剤とを含む。

【0029】

この組成物は、多くの剤型から選択することができ、そのうちの多くは、the Manual on Development and Use of FAO Specifications for Plant Protection Products, 5th Edition, 1999から公知である。これらとしては、粉剤(DP)、水溶剤(SP)、水溶顆粒(SG)、水和性顆粒(WG)、水和剤(WP)、粒剤(GR)(徐放性又は即放性)、可溶濃縮剤(SL)、油混和性液剤(OL)、超低量液剤(UL)、乳化性濃縮物(EC)、分散性濃縮物(DC)、乳剤(水中油(EW)及び油中水(EO)の両方)、マイクロエマルジョン(ME)、懸濁液濃縮物(SC)、エアゾール、カプセル懸濁剤(CS)及び種子処理製剤が挙げられる。いずれの場合も、選択される剤型は、想定される具体的な目的並びに式(I)の化合物の物理的、化学的及び生物学的特性に応じて決まるであろう。

10

【0030】

粉剤(DP)は、式(I)の化合物を1種以上の固体希釈剤(例えば、天然粘土、カオリン、葉ろう石、ベントナイト、アルミナ、モンモリロナイト、キーゼルグール、チョーク、珪藻土、リン酸カルシウム、炭酸カルシウム及び炭酸マグネシウム、硫黄、石灰、小麦粉、タルク及び他の有機及び無機固体担体)と混合し、この混合物を微粉末に機械的に粉砕することによって調製され得る。

20

【0031】

水溶剤(SP)は、水への分散性/溶解性を改善するために、式(I)の化合物を1種以上の水溶性無機塩(炭酸水素ナトリウム、炭酸ナトリウム又は硫酸マグネシウムなど)又は1種以上の水溶性有機固体(多糖など)及び任意に1種以上の湿潤剤、1種以上の分散剤又は前記物質の混合物と混合することによって調製され得る。次に、この混合物は、微粉末に粉砕される。また、同様の組成物を造粒して、水溶顆粒(SG)を形成し得る。

【0032】

水和剤(WP)は、式(I)の化合物を1種以上の固体希釈剤又は担体、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1種以上の懸濁化剤と混合して、液体中の分散を促進することによって調製され得る。次に、この混合物は、微粉末に粉砕される。また、同様の組成物を造粒して、水和性顆粒(WG)を形成し得る。

30

【0033】

粒剤(GR)は、式(I)の化合物と1種以上の粉末化された固体希釈剤又は担体との混合物を造粒することによるか、或いは式(I)の化合物(又は好適な物質中のその溶液)を多孔質の顆粒物質(軽石、アタパルジャイト粘土、フラート、キーゼルグール、珪藻土又は粉砕されたトウモロコシの穂軸など)中に吸収することによるか、又は式(I)の化合物(又は好適な物質中のその溶液)を硬質のコア材(砂、ケイ酸塩、無機の炭酸塩、硫酸塩又はリン酸塩など)上に吸着し、必要に応じて乾燥させることにより、予め形成されたブランク顆粒から造粒することによるかのいずれかによって形成され得る。吸収又は吸着を補助するのに一般的に使用される物質としては、溶媒(脂肪族及び芳香族石油系溶媒、アルコール、エーテル、ケトン及びエステルなど)及び固着剤(ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、デキストリン、糖類及び植物油など)が挙げられる。また、1種以上の他の添加剤が粒剤に含まれ得る(例えば、乳化剤、湿潤剤又は分散剤)。

40

【0034】

分散性濃縮物(DC)は、式(I)の化合物を水又はケトン、アルコール若しくはグリコールエーテルなどの有機溶媒に溶解させることによって調製され得る。これらの溶液は、(例えば、水希釈性を改善するか、又は噴霧タンク中の結晶化を防止するために)表面

50

活性剤を含有し得る。

【0035】

乳化性濃縮物（EC）又は水中油型乳剤（EW）は、式（I）の化合物を有機溶媒（1種以上の湿潤剤、1種以上の乳化剤又は前記物質の混合物を任意に含有する）に溶解させることによって調製され得る。ECに使用するのに適した有機溶媒としては、芳香族炭化水素（SOLVESSO 100、SOLVESSO 150及びSOLVESSO 200によって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；SOLVESSOは、登録商標である）、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<sub>8</sub>~C<sub>10</sub>脂肪酸の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製品は、水に加えると自然に乳化して、適切な装置によって噴霧施用可能なほど十分な安定性を有する乳剤を生成し得る。

10

【0036】

EWの調製は、式（I）の化合物を液体として（それが室温で液体でない場合、適当な温度、典型的に70 未満で溶融させ得る）又は溶液中において（それを適切な溶媒に溶解させることによって）得るステップと、次に得られた液体又は溶液を高せん断下で1種以上のSFAを含有する水に乳化して、乳剤を生成するステップとを含む。EWに使用するのに適した溶媒としては、植物油、塩素化炭化水素（クロロベンゼンなど）、芳香族溶媒（アルキルベンゼン又はアルキルナフタレンなど）及び水溶性の低い他の適切な有機溶媒が挙げられる。

20

【0037】

マイクロエマルジョン（ME）は、水を1種以上のSFAと1種以上の溶媒とのブレンドと混合して、熱力学的に安定した等方性液体製剤を自然に生じさせることによって調製され得る。式（I）の化合物は、最初、水又は溶媒/SFAブレンドのいずれかの中に存在する。MEに使用するのに適した溶媒としては、EC又はEWへの使用に関して上述したものが挙げられる。MEは、水中油型又は油中水型系のいずれかであり得（いずれの系が存在するかは、伝導度測定によって決定され得る）、水溶性及び油溶性有害生物防除剤を同じ製剤中で混合することに適し得る。MEは、水に希釈するのに適しており、マイクロエマルジョンのまま残るか又は従来の中油乳剤を形成する。

30

【0038】

懸濁液濃縮物（SC）は、式（I）の化合物の微粉化された不溶性固体粒子の水性又は非水性懸濁液を含み得る。SCは、好適な媒体中において、式（I）の固体化合物を任意に1種以上の分散剤と共にボールミル粉碎又はビーズミル粉碎して、この化合物の微粒子懸濁液を生成することによって調製され得る。1種以上の湿潤剤が組成物に含まれ得、粒子の沈降速度を低下させるために懸濁化剤が含まれ得る。代わりに、式（I）の化合物は、乾式ミル粉碎され、上述した物質を含有する水に加えられて所望の最終生成物を生成し得る。

【0039】

エアゾール製剤は、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、好適な媒体（例えば、水又はn-プロパノールなどの水混和性液体）にも溶解又は分散されて、非加圧式の手動噴霧ポンプで使用するための組成物が得られる。

40

【0040】

カプセル懸濁剤（CS）は、各油滴がポリマーシェルによって封入され、且つ式（I）の化合物と、任意に、そのための担体又は希釈剤とを含有する油滴の水性分散液が得られる追加の重合段階を伴う以外は、EW製剤の調製と同様の方法で調製され得る。ポリマーシェルは、界面重縮合反応又はコアセルベーション手順のいずれかによって生成され得る。この組成物は、式（I）の化合物の制御放出を提供し、種子処理に使用され得る。式（I）の化合物は、生分解性ポリマーマトリックス中で製剤化されて、この化合物の遅延制

50

御放出を提供することもできる。

【0041】

組成物は、例えば、表面上の湿潤、保持又は分散；処理された表面における耐雨性；又は式（I）の化合物の取り込み又は移動性を改善することにより、組成物の生物学的性能を改善するために1種以上の添加剤を含み得る。このような添加剤としては、表面活性剤（SFA）、油系噴霧添加剤、例えば特定の鉱油又は天然植物油（ダイズ油及びナタネ油など）及びこれらと他の生物学的強化助剤（式（I）の化合物の作用を補助又は調整し得る成分）とのブレンドが挙げられる。

【0042】

湿潤剤、分散剤及び乳化剤は、カチオン型、アニオン型、両性型又は非イオン型のSFAであり得る。

【0043】

好適なカチオン型のSFAとしては、第四級アンモニウム化合物（例えば、臭化セチルトリメチルアンモニウム）、イミダゾリン及びアミン塩が挙げられる。

【0044】

好適なアニオン型SFAとしては、脂肪酸のアルカリ金属塩、硫酸の脂肪族モノエステルの塩（例えば、ラウリル硫酸ナトリウム）、スルホン化された芳香族化合物の塩（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、スルホン酸ブチルナフタレン並びにジ-イソプロピル-及びトリ-イソプロピル-ナフタレンスルホン酸ナトリウムの混合物）、硫酸エーテル、硫酸アルコールエーテル（例えば、ラウレス-3-硫酸ナトリウム）、カルボン酸エーテル（例えば、ラウレス-3-カルボン酸ナトリウム）、リン酸エステル（1種以上の脂肪族アルコールとリン酸との反応からの生成物（主にモノ-エステル）又は五酸化リン（主にジ-エステル）、例えばラウリルアルコールとテトラリン酸との反応物；さらに、これらの生成物は、エトキシ化され得る）、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ネート、タウレート及びリグノスルホネートが挙げられる。

【0045】

好適な両性型のSFA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。

【0046】

好適な非イオン型のSFAとしては、エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドなどのアルキレンオキシド又はそれらの混合物の、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）又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）との縮合生成物；長鎖脂肪酸又は無水ヘキシトールから誘導される部分エステル；前記部分エステルのエチレンオキシドとの縮合生成物；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；単純なエステル（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）；及びレシチンが挙げられる。

【0047】

好適な懸濁化剤としては、親水コロイド（多糖類、ポリビニルピロリドン又はカルボキシメチルセルロースナトリウムなど）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。

【0048】

本発明の化合物は、1種以上の追加の除草剤及び/又は植物成長調節剤との混合物でも使用可能である。このような追加の除草剤又は植物成長調節剤の例としては、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、アミノカルパゾン、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）、ベントゾン、ピシクロピロン、ピラナホス、ピピラゾン、ビスピリバック-ナトリウ

10

20

30

40

50

ム、ピクスロゾン、プロマシル、プロモキシニル、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）、クロトルロン、クロルスルフロソ、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 - プロバルギルを含む）、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、シクロスルファミロン、シハロホップ（シハロホップ - ブチルを含む）、2, 4 - D（コリン塩及びその2 - エチルヘキシルエステルを含む）、2, 4 - DB、デスメディファミン、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、ジクロロプロブ、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、フラザスルフロソ、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）、フルフェナセット、フルメツラム、フルミオキサジン、フルオメツロン、ホメサフェン、フルピルスルフロソ（フルピルスルフロソ - 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 - メチルを含む）、ホメサフェン、ホラムスルフロソ、グルホシネート（両方のL - グルホシネート及び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、イオドスルフロソ（イオドスルフロソ - メチル - ナトリウムを含む）、イオフENSルフロソ（イオフENSルフロソ - ナトリウムを含む）、アイオキシニル、イソプロツロン、イソキサフルツール、ランコトリオン、MC PA、MC PB、メコプロップ - P、メソスルフロソ（メソスルフロソ - 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、メトスルフロソ、ナプロパミド、ニコスルフロソ、ノルフラゾン、オキサジアゾン、オキサスルフロソ、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、フェンメディファミン、ピクロラム、ピノキサデン、プレチラクロール、プリミスルフロソ - メチル、プロメトリン、プロパニル、プロパキサホップ、プロピルスルフロソ、プロピザミド、プロスルホカルブ、プロスルフロソ、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）、ピラスルホツール、ピリデート、ピリフタリド、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、キサロホップ（キサロホップ - P - エチル及びキサロホップ - P - テフリルを含む）、リミソキサフェン、リムスルフロソ、サフルフェナシル、セトキシジム、シマジン、S - メトラクロール、スルフェントラゾン、スルホスルフロソ、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、チフェンスルフロソ、チアフェナシル、トルピラレート、トブラメゾン、トラルコキシジム、トリアファモネ、トリアレート、トリアスルフロソ、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ソ（トリフロキシスルフロソ - 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、トリフルスルフロソ、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 -

10

20

30

40

50

[ 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、 ( 4 R ) 1 - ( 5 - tert - ブチリスブチルイソキサゾール - 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、 4 - アミノ - 3 - クロロ - 5 - フルオロ - 6 - ( 7 - フルオロ - 1 H - インドール - 6 - イル ) ピリジン - 2 - カルボン酸 ( その農芸化学的に許容可能なエステル、例えばメチル 4 - アミノ - 3 - クロロ - 5 - フルオロ - 6 - ( 7 - フルオロ - 1 H - インドール - 6 - イルを含む ) ピリジン - 2 - カルボキシレート、プロブ - 2 - イニル 4 - アミノ - 3 - クロロ - 5 - フルオロ - 6 - ( 7 - フルオロ - 1 H - インドール - 6 - イル ) ピリジン - 2 - カルボキシレート及びシアノメチル 4 - アミノ - 3 - クロロ - 5 - フルオロ - 6 - ( 7 - フルオロ - 1 H - インドール - 6 - イル ) ピリジン - 2 - カルボキシレート )、 3 - エチル - スルファニル - N - ( 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル ) - 5 - (トリフルオロメチル) - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 8 - カルボキサミド、 3 - (イソプロピルスルファニルメチル) - N - ( 5 - メチル - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル ) - 5 - (トリフルオロメチル) - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 8 - カルボキサミド、 3 - (イソプロピルスルホニル - メチル) - N - ( 5 - メチル - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル ) - 5 - (トリフルオロメチル) - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] - ピリジン - 8 - カルボキサミド、 3 - (エチルスルホニルメチル) - N - ( 5 - メチル - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル ) - 5 - (トリフルオロメチル) - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 8 - カルボキサミド、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、 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、テトラヒドロ - フラン - 2 - イルメチル ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - アミノ - 3 , 5 - ジクロロ - 6 - フルオロ - 2 - ピリジル ) オキシ ] - プロパノエート、 ( 2 R ) - 2 - [ ( 4 - アミノ - 3 , 5 - ジクロロ - 6 - フルオロ - 2 - ピリジル ) オキシ ] プロパン酸、テトラヒドロフラン - 2 - イルメチル 2 - [ ( 4 - アミノ - 3 , 5 - ジクロロ - 6 - フルオロ - 2 - ピリジル ) オキシ ] プロパノエート、 2 - [ ( 4 - アミノ - 3 , 5 - ジクロロ - 6 - フルオロ - 2 - ピリジル ) オキシ ] プロパン酸、 2 - フルオロ - N - ( 5 - メチル - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル ) - 3 - [ ( R ) - プロピルスルフィニル ] - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、 2 - フルオロ - N - ( 5 - メチル - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル ) - 3 - プロピルスルフィニル - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、 ( 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、 3 - ( 3 - クロロフェニル ) - 6 - ( 5 - ヒドロキシ - 1 , 3 - ジメチル - ピラゾール - 4 - カルボニル ) - 1 , 5 - ジメチル - キナゾリン - 2 , 4 - ジオン及び [ 4 - [ 3 - ( 3 - クロロフェニル ) - 1 , 5 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - キナゾリン - 6 - カルボニル ] - 2 , 5 - ジメチル - ピラゾール - 3 - イル ] N , N - ジエチルカルバメートが挙げられる。

## 【 0 0 4 9 】

式 I の化合物の混合パートナーは、例えば、The Pesticide Manual, Sixteenth Edition, British Crop Protection Council, 2012 で言及されているように、エステル又は塩の形態でもあり得る。

## 【 0 0 5 0 】

式 I の化合物は、殺真菌剤、殺線虫剤又は殺虫剤などの他の農薬との混合物中で使用することもでき、その例が、The Pesticide Manual に示されている。

## 【 0 0 5 1 】

混合パートナーに対する式 I の化合物の混合比は、好ましくは、1 : 1 0 0 ~ 1 0 0 0 : 1 である。

## 【 0 0 5 2 】

混合物は、上記の製剤に有利に使用され得る（その場合、「有効成分」は、混合パートナーとの式 I の化合物のそれぞれの混合物に関する）。

## 【 0 0 5 3 】

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され得る。このような毒性緩和剤の例としては、ペノキサコール、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。

10

## 【 0 0 5 4 】

式 I の化合物の毒性緩和剤は、例えば、The Pesticide Manual, 16<sup>th</sup> Edition (BCPC), 2012 に記載されているとおり、エステル又は塩の形態でもあり得る。クロキントセットメキシルに対する言及は、国際公開第 0 2 / 3 4 0 4 8 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、フェンクロラゾール - エチルに対する言及は、フェンクロラゾール等にも適用される。

20

## 【 0 0 5 5 】

好ましくは、式 I の化合物対毒性緩和剤の混合比は、1 0 0 : 1 ~ 1 : 1 0、特に 2 0 : 1 ~ 1 : 1 である。

## 【 0 0 5 6 】

混合物は、上記の配合物で有利に使用され得る（この場合、「有効成分」は、式 I の化合物と毒性緩和剤とのそれぞれの混合物に関する）。

## 【 0 0 5 7 】

本発明は、生息地において雑草を防除する方法をさらに提供し、前記方法は、雑草の生息地に対する、防除量の式 ( I ) の化合物を含む組成物の適用を含む。また、本発明は、作物植物及び雑草を含む生息地において雑草を選択的に防除する方法をさらに提供し、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、死滅、成長の低減若しくは遅延又は発芽の防止若しくは低減を意味する。一般に、防除される植物は、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成長するであろう領域を意味する。いくつかの作物植物は、式 ( I ) の化合物の除草効果に対して先天的に耐性であり得る。しかしながら、いくつかの事例では、耐性は、例えば、遺伝子操作によって作物植物に人工的に導入する必要性があり得る。従って、遺伝子操作により、HPPD 阻害剤に対する耐性を作物植物に与えることが可能である。HPPD 阻害剤に対する耐性を作物植物に与える方法は、例えば、国際公開第 0 2 4 6 3 8 7 号から公知である。従って、より好ましい実施形態では、作物植物は、バクテリア、より具体的にはシュードモナス・フルオレッセンス ( *Pseudomonas fluorescens* ) 若しくはシュワネラ・コルウェリアナ ( *Shewanella colwelliana* ) 由来の HPPD 阻害剤耐性 HPPD 酵素又は植物、より具体的には単子葉植物若しくはさらにより具体的にはオオムギ、トウモロコシ、コムギ、イネ、ブラキアリア属 ( *Brachiaria* )、ケンクルス属 ( *Cenchrus* )、ドクムギ属 ( *Lolium* )、ウシノケグサ属 ( *Festuca* )、セタリア属 ( *Setaria* )、オヒシバ属 ( *Eleusine* )、モロコシ属 ( *Sorghum* ) 若しくはカラスムギ属 ( *Avena* ) 種由来の HPPD 阻害剤耐性 HPPD 酵素をコードする DNA 配列を含むポリヌクレ

30

40

50

オチドに関して、トランスジェニックである。数々のHPPD-耐性ダイズトランスジェニック「イベント」は公知であり、例えばSYHT04R（国際公開第2012/082542号）、SYHT0H2（国際公開第2012/082548号）及びFG72が含まれる。本発明の化合物に耐性である植物をもたらすために使用可能である他のポリヌクレオチド配列は、例えば、国際公開第2010/085705号及び国際公開第2011/068567号に開示されている。従って、本発明に係る組成物を使用可能である作物植物は、例えば、オオムギ及びコムギといった穀類、綿、アブラナ、ヒマワリ、トウモロコシ、イネ、ダイズ、サトウダイコン、サトウキビ及び芝生などの作物を含む。

【0058】

作物植物は、果樹、ヤシの木、ココナツの木又は他の堅果などの樹木も含み得る。ブドウ、低木性の果樹、果実植物及び野菜などのつる植物も含まれる。

【0059】

式Iの化合物の施用率は、広い限度内で変化し、土壌の性質、施用方法（出芽前又は出芽後；種子粉衣；まき溝への施用；非耕地施用など）、作物、防除される雑草、一般的気候条件及び施用方法によって左右される他の要因、施用時間及び標的作物に応じて決まり得る。本発明に係る式Iの化合物は、一般に、10~2000g/ha、特に50~1000g/haの率で施用される。

【0060】

施用は、一般に、組成物を噴霧することにより、典型的に広い領域のためのトラクターに取り付けられた噴霧器によってなされるが、散粉（粉剤用）、点滴又は灌注などの他の方法を使用することもできる。

【0061】

作物は、従来品種改良方法又は遺伝子組み換えによって除草剤又は除草剤の種類（例えば、ALS-、GS-、EPSPS-、PPO-、ACCase-及びHPPD阻害剤）に対する耐性を与えられた作物も含むことが理解されるべきである。従来品種改良方法によってイミダゾリノン、例えばイマザモックスに対する耐性を与えられた作物の一例は、Clearfield（登録商標）夏ナタネ（キャノーラ）である。遺伝子組み換え方法によって除草剤に対する耐性を与えられた作物の例としては、例えば、Roundup Ready（登録商標）及びLiberty Link（登録商標）の商標名で市販されているグリホサート耐性及びグルホシネート耐性トウモロコシ種が挙げられる。

【0062】

作物は、遺伝子組み換え方法によって害虫に対する耐性を与えられた作物、例えばBtトウモロコシ（アワノメイガに耐性がある）、Bt綿花（メキシコワタノミゾウムシに耐性がある）及びさらにBtジャガイモ（コロラドハムシに耐性がある）でもあることが理解されるべきである。Btトウモロコシの例は、NK（登録商標）（Syngenta Seeds）のBt 176トウモロコシ雑種である。Bt毒素は、バチルス・チューリゲンシス（*Bacillus thuringiensis*）土壌細菌によって天然に形成されるタンパク質である。毒素又はこのような毒素を合成することができるトランスジェニック植物の例が、欧州特許出願公開第451878号明細書、欧州特許出願公開第374753号明細書、国際公開第93/07278号、国際公開第95/34656号、国際公開第03/052073号及び欧州特許出願公開第427529号明細書に記載されている。殺虫剤耐性をコードし、1つ又は複数の毒素を発現する1つ又は複数の遺伝子を含むトランスジェニック植物の例は、KnockOut（登録商標）（トウモロコシ）、Yield Guard（登録商標）（トウモロコシ）、NuCOTIN33B（登録商標）（綿花）、Bollgard（登録商標）（綿花）、NewLeaf（登録商標）（ジャガイモ）、NatureGuard（登録商標）及びProtecta（登録商標）である。植物作物又はその種子材料のいずれも除草剤に対して耐性があると同時に、昆虫の摂食に対して耐性があり得る（「多重」トランスジェニック事象）。例えば、種子は、殺虫性のCry3タンパク質を発現する能力を有すると同時にグリホサートに対して耐性がある。

## 【0063】

作物は、従来の品種改良方法又は遺伝子組み換えによって得られ、いわゆる出力形質（例えば、向上した貯蔵安定性、より高い栄養価及び向上した風味）を含む作物も含むことが理解されるべきである。

## 【0064】

他の有用な植物は、例えば、ゴルフ場、芝地、公園及び沿道における芝草又は芝生のために商業的に栽培された芝草及び花又は低木などの鑑賞植物を含む。

## 【0065】

組成物は、好ましくない植物（総称して「雑草」）を防除するのに使用され得る。防除される雑草は、単子葉植物種、例えばコヌカグサ属（*Agrostis*）、スズメノテッポウ属（*Alopecurus*）、カラスムギ属（*Avena*）、ビロードキビ属（*Brachiaria*）、スズメノチャヒキ属（*Bromus*）、クリノイガ属（*Cenchrus*）、カヤツリグサ属（*Cyperus*）、メヒシバ属（*Digitaria*）、ヒエ属（*Echinochloa*）、オヒシバ属（*Eleusine*）、ドクムギ属（*Lolium*）、ミズアオイ属（*Monochoria*）、ツノアイアシ属（*Rottboellia*）、オモダカ属（*Sagittaria*）、ホタルイ属（*Scirpus*）、エノコログサ属（*Setaria*）及びモロコシ属（*Sorghum*）並びに双子葉植物種、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*）、ホオランダガラシ属（*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*）、スミレ属（*Viola*）及びオナモミ属（*Xanthium*）の両方であり得る。雑草は、作物ともみなされ得るが、作物の領域の外側で成長する植物（「エスケープ（escape）」）又は前に植えられていた異なる作物から残された種子から成長する植物（「ボランティア（volunteer）」）を含み得る。このようなボランティア又はエスケープは、特定の他の除草剤に対して耐性であり得る。

10

20

## 【0066】

本発明の化合物は、以下のスキームに従って調製可能である。

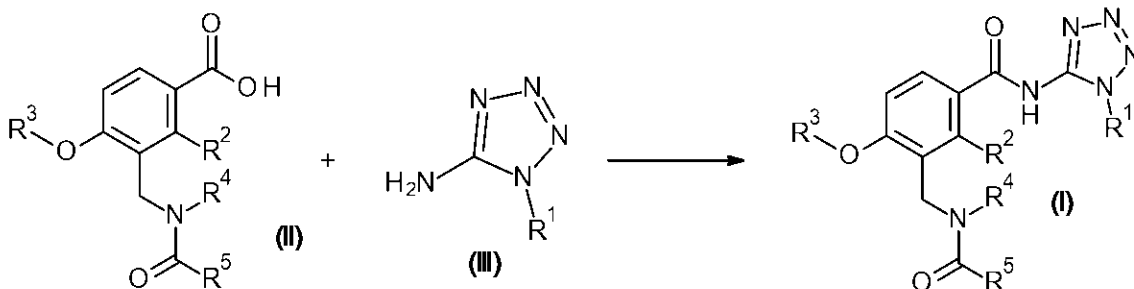
30

## 【0067】

スキーム 1

式（I）の化合物は、式（II）の安息香酸及び式（III）のアミンから調製され得る。

## 【化3】



40

## 【0068】

上記のスキームに従い、式（II）の安息香酸及び式（III）のアミンを好適なアミドカップリング試薬で好適な溶剤中において処理する。反応速度を高める添加剤を任意に添加してもよい。好適なアミドカップリング試薬の一例は、塩化チオニルである。好適な溶剤の一例は、ピリジンである。好適な添加剤の一例は、N-メチルイミダゾールである。

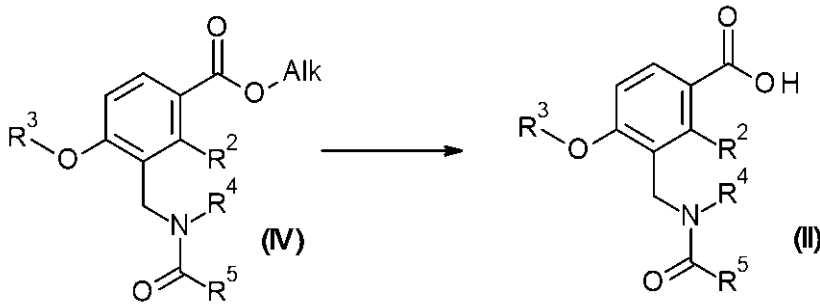
50

【 0 0 6 9 】

スキーム 2

式 ( I I ) の安息香酸は、式 ( I V ) の加水分解エステル ( ここで、「 A l k 」は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>アルキル基と定義される ) から調製され得る。

【 化 4 】



10

【 0 0 7 0 】

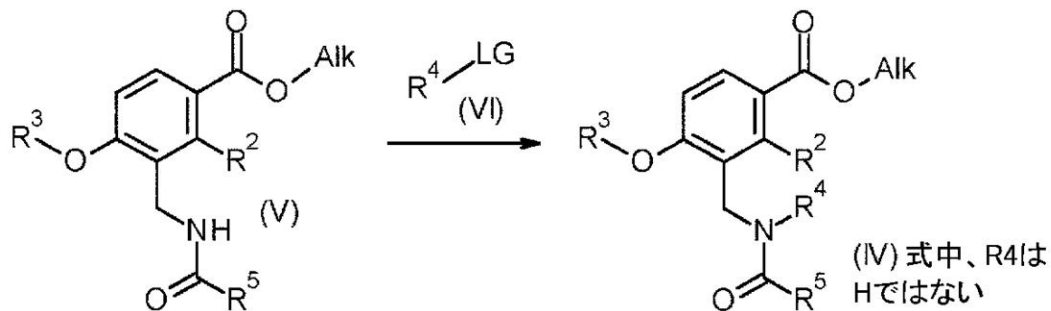
式 ( I V ) の安息香酸を水酸化物塩基、例えば水酸化ナトリウムで好適な溶剤、例えばエタノール : 水の 3 : 1 混合物中において処理して、式 ( I I ) の化合物が得られる。

【 0 0 7 1 】

スキーム 3

式 ( I V ) の化合物 ( ここで、R<sup>4</sup>は、水素ではない ) は、式 ( V ) の化合物から調製され得る。

【 化 5 】



30

【 0 0 7 2 】

式 ( V ) の化合物を塩基、例えば水酸化ナトリウム及び式 ( V I ) の化合物 ( ここで、L G は、脱離基と定義される ) で処理する。好適な脱離基の一例は、ヨウ化物である。例えば、R<sup>4</sup>がメチルである場合、式 ( V I ) の化合物は、ヨードメタンである。

【 0 0 7 3 】

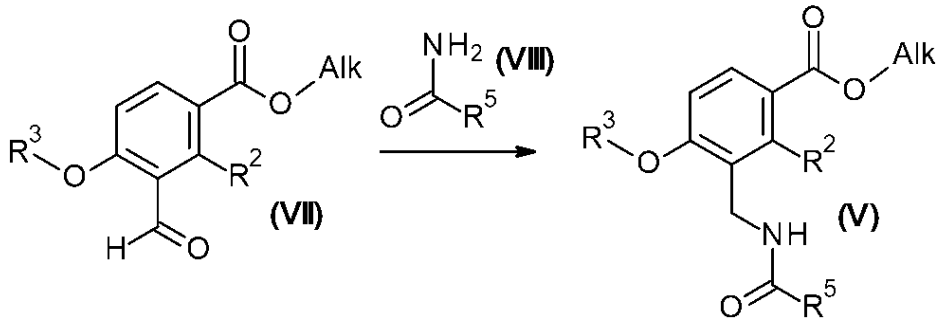
スキーム 4

式 ( V ) の化合物は、式 ( V I I ) のアルデヒド及び式 ( V I I I ) の第 1 級アミドから調製され得る。

40

50

## 【化6】



10

## 【0074】

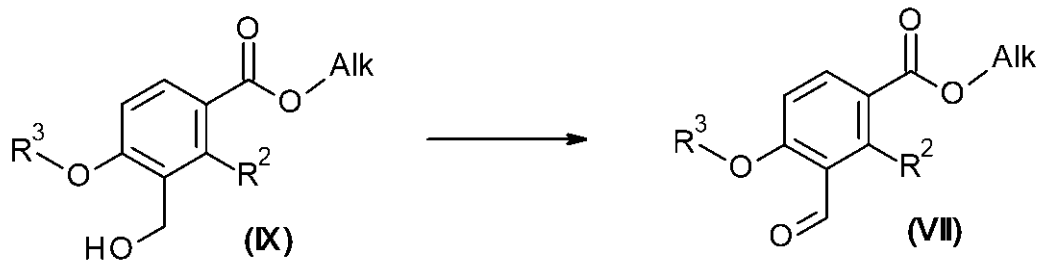
式(VII)の化合物及び式(VIII)の化合物を酸、例えばトリフルオロ酢酸及び還元剤、例えばトリエチルシランで好適な溶剤、例えばトルエン中において処理する。

## 【0075】

スキーム6

式(VII)の化合物は、式(IX)のアルデヒドから調製され得る。

## 【化7】



20

## 【0076】

式(IX)の化合物を酸化剤、例えばデスマーチンペルヨージナンで好適な溶剤、例えばベンゾトリフルオリド中において処理して、式(VII)の化合物が得られる。

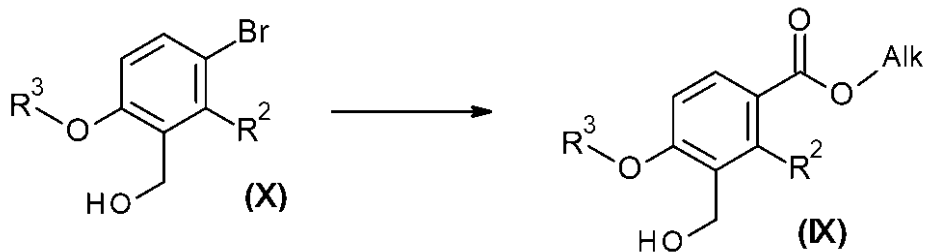
30

## 【0077】

スキーム7

式(IX)の化合物は、式(X)の臭化アリーのカルボニル化によって得られる。

## 【化8】



40

## 【0078】

式(X)の化合物を、オートクレーブ中において、例えば10barなどの好適な圧力の一酸化炭素ガスで好適な触媒、例えば[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム(II)及び好適な塩基、例えばトリエチルアミンと共に処理する。溶剤は、Alk-OHである。例えば、溶剤がメタノールである場合、上記のスキームに示す「Alk」は、メチルとなる。

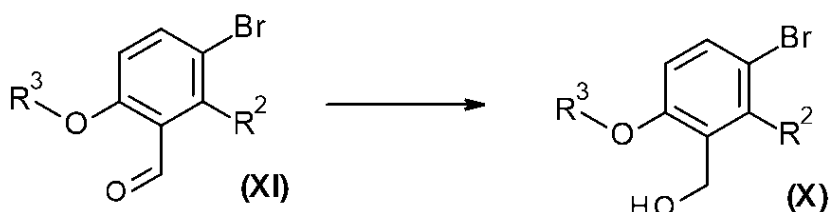
## 【0079】

スキーム8

50

式 ( X ) の化合物は、式 ( X I ) の化合物から調製され得る。

【化 9】



【 0 0 8 0 】

10

式 ( X I ) の化合物を還元剤、例えば水素化ホウ素ナトリウムで好適な溶剤、例えばメタノール中において処理する。

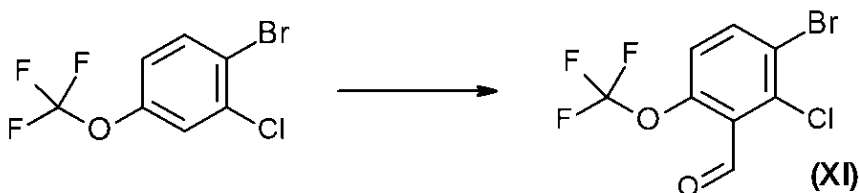
【 0 0 8 1 】

スキーム 9

式 ( X I ) の化合物は、 $R^3$  及び  $R^2$  の性質に応じて異なる方法で調製され得る。一例として、 $R^3$  がトリフルオロメチルであり、及び  $R^2$  がクロロである場合、式 ( X ) の化合物は、市販されている 1 - ブロモ - 2 - クロロ - 4 - ( トリフルオロメトキシ ) ベンゼンから調製され得る。

【化 1 0】

20



【 0 0 8 2 】

1 - ブロモ - 2 - クロロ - 4 - ( トリフルオロメトキシ ) ベンゼンを塩基、例えばリチウムジイソプロピルアミドで好適な溶剤、例えばテトラヒドロフラン中において処理する。次いで、この反応に  $N, N$  - ジメチルホルムアミドを添加して、式 ( X I ) の化合物が得られる。

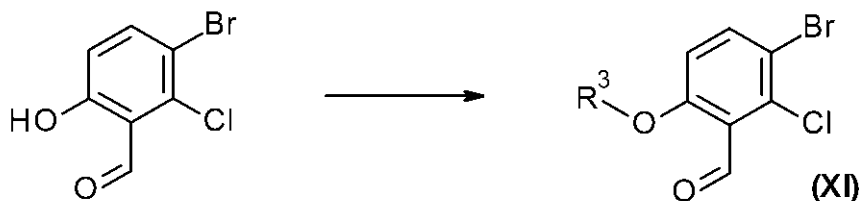
30

【 0 0 8 3 】

スキーム 1 0

$R^2$  がクロロであり、及び  $R^3$  がトリフルオロメチルではない場合、式 ( X ) の化合物は、市販されている 5 - ブロモ - 6 - クロロ - 2 - ヒドロキシベンズアルデヒドから調製され得る。

【化 1 1】



40

【 0 0 8 4 】

5 - ブロモ - 6 - クロロ - 2 - ヒドロキシベンズアルデヒドを、 $R^3$  の性質に応じた試薬で処理する。当業者は、これらの試薬を熟知していると共に、いずれの試薬がいずれの  $R^3$  に対応するかを熟知している。例えば、 $R^3$  がジフルオロメチルである場合、好適な試薬の一例は、ジエチル ( プロモジフルオロメチル ) ホスホネートである。

【 0 0 8 5 】

50

以下の非限定的な例は、本明細書に記載の表 1 で参照される本発明の代表的な化合物の特定の合成方法を提供する。

【実施例】

【0086】

実施例 1：化合物 1.003 の調製。

ステップ 1：3-ブロモ-2-クロロ-6-(トリフルオロメトキシ)ベンズアルデヒドの調製

1-ブロモ-2-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゼン(15 g、54 mmol)の THF (300 mL) 中の攪拌溶液に THF (32 mL) 中のリチウムジイソプロピルアミド(2.0 mol/L)を -78 で滴下し、反応を同じ温度で 1 時間攪拌した。この溶液に無水 DMF (8.4 mL、107.82 mmol) を添加し、反応を -78 でさらに 0.5 時間攪拌した。完了した後、混合物を水性 1 N HCl の滴下によって失活させた。得られた水溶液を酢酸エチル(3 x 50 mL)で抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮して粗生成物を得、これをシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィ(シクロヘキサン：酢酸エチル勾配 99：1 ~ 90：10)によって精製して、3-ブロモ-2-クロロ-6-(トリフルオロメトキシ)ベンズアルデヒド(13.0 g、76%)を黄色の油として得た。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) ppm 10.28 (s, 1H) 8.18 (d, 1H) 7.52 (d, 1H)

10

【0087】

ステップ 2：[3-ブロモ-2-クロロ-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メタノールの調製

3-ブロモ-2-クロロ-6-(トリフルオロメトキシ)ベンズアルデヒド(13.0 g、42.8 mmol)のメタノール(95 mL)中の攪拌溶液に水素化ホウ素ナトリウム(2.27 g、60.0 mmol)を 0 で数回に分けて添加した。次いで、反応塊を周囲温度で 2 時間攪拌した。完了した後、氷冷水をゆっくりと添加して過剰量の水素化ホウ素ナトリウムを失活させ、次いでこれを濃縮してメタノールを低減させた。得られた溶液を 2 N HCl で酸性化し、酢酸エチル(3 x 30 mL)で抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濃縮して、[3-ブロモ-2-クロロ-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メタノール(13.0 g、99%収率)を薄い黄色の油として得た。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) ppm 7.88 (d, J = 9.03 Hz, 1H) 7.36 (d, J = 8.78 Hz, 1H) 5.38 (t, J = 5.40 Hz, 1H) 4.65 (d, J = 5.52 Hz, 2H)

20

30

【0088】

ステップ 3：メチル 2-クロロ-3-(ヒドロキシメチル)-4-(トリフルオロメトキシ)安息香酸塩の調製

[3-ブロモ-2-クロロ-6-(トリフルオロメトキシ)フェニル]メタノール(13.0 g、42.6 mmol)のメタノール(130 mL)中の溶液に 1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン-パラジウム(II)ジクロリドジクロロメタン錯体(7 g、8.51 mmol)及びトリエチルアミン(12 mL、85.1 mmol)を添加した。反応混合物を 95 で一酸化炭素雰囲気(10 atm)下に 6 時間攪拌した。反応後、混合物を周囲温度に冷却し、水(100 mL)で希釈した。得られた水溶液を酢酸エチル(3 x 50 mL)で抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して粗残渣を得た。粗残渣をシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィ(シクロヘキサン：酢酸エチル溶離液勾配 99：1 ~ 80：20)によって精製して、メチル 2-クロロ-3-(ヒドロキシメチル)-4-(トリフルオロメトキシ)安息香酸塩(9.0 g、68%収率)を黄色の油として得た。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) ppm 7.83 (d, 1H) 7.50 (d, 1H) 5.36 (t, 1H) 4.65 (d, 2H) 3.89 (s, 3H)

40

【0089】

50

ステップ4：メチル2-クロロ-3-ホルミル-4-(トリフルオロメトキシ)安息香酸塩の調製

メチル2-クロロ-3-(ヒドロキシメチル)-4-(トリフルオロメトキシ)安息香酸塩(5.0g、18mmol)のトリフルオロメチルベンゼン(50mL)中の攪拌溶液に0~10でデスマーチンペルヨージン(15g、35mmol)を数回に分けて添加した。この反応を周囲温度で3時間攪拌し続けた。完了した後、反応混合物を10に冷却し、飽和NaHCO<sub>3</sub>溶液で希釈した。得られた水溶液を酢酸エチル(3×25mL)で抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して粗残渣を得た。粗残渣をシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィ(シクロヘキサン：酢酸エチル溶離液勾配99：1~70：30)によって精製して、メチル2-クロロ-3-ホルミル-4-(トリフルオロメトキシ)安息香酸塩(3.0g、60%収率)を黄色の固体として得た。<sup>1</sup>H NMR(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) ppm 10.35(s, 1H) 8.12(d, J = 8.80 Hz, 1H) 7.66(d, J = 8.68, 1H) 3.91(s, 3H)

10

【0090】

ステップ5：メチル2-クロロ-3-[(プロパノイルアミノ)メチル]-4-(トリフルオロメトキシ)安息香酸塩の調製

マイクロ波バイアルにプロパンアミド(776mg、10.62mmol)、2,2,2-トリフルオロ酢酸(0.82mL、11mmol)、メチル2-クロロ-3-ホルミル-4-(トリフルオロメトキシ)安息香酸塩(1.00g、3.54mmol、100mL)、トリエチルシラン(1.7mL、11mmol)を添加し、トルエン(15mL)中で攪拌した。反応混合物をMW中において160で2時間加熱した。次いで、反応混合物を減圧下で濃縮し、残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィ(シクロヘキサン中の酢酸エチルの0~50%勾配)によって精製した。画分を含有する生成物を組み合わせ、減圧中で濃縮して、メチル2-クロロ-3-[(プロパノイルアミノ)メチル]-4-(トリフルオロメトキシ)安息香酸塩を白色の固体(540mg、1.590mmol、45%)として得た。<sup>1</sup>H NMR(400MHz, クロロホルム) = 7.82-7.75(m, 1H), 7.31-7.25(m, 1H), 5.71-5.60(m, 1H), 4.75-4.68(m, 2H), 3.98-3.93(m, 3H), 2.25-2.14(m, 2H), 1.14(t, J = 7.6 Hz, 3H)

20

30

【0091】

ステップ6：2-クロロ-3-[(プロパノイルアミノ)メチル]-4-(トリフルオロメトキシ)安息香酸の調製

メチル2-クロロ-3-[(プロパノイルアミノ)メチル]-4-(トリフルオロメトキシ)安息香酸塩(0.300g、0.883mmol)のテトラヒドロフラン(3.6mL)及び水(0.9mL)中の攪拌溶液に室温で水酸化リチウム一水和物(0.111g、2.65mmol)を添加した。混合物を室温で一晩攪拌した。反応を2M水性HCl(10mL)の添加で失活させた。混合物を室温でさらに5分間攪拌し、続いて酢酸エチルで3回抽出した。組み合わせた有機相を減圧中で濃縮して、2-クロロ-3-[(プロパノイルアミノ)メチル]-4-(トリフルオロメトキシ)安息香酸(0.274g、0.841mmol、95%)をベージュ色の固体として得た。<sup>1</sup>H NMR(400MHz, メタノール) = 7.91-7.75(m, 1H), 7.45-7.34(m, 1H), 4.66-4.54(m, 2H), 2.25-2.11(m, 2H), 1.17-0.99(m, 3H)

40

【0092】

ステップ7：2-クロロ-N-(1-メチルテトラゾール-5-イル)-3-[(プロパノイルアミノ)メチル]-4-(トリフルオロメトキシ)ベンズアミドの調製

2-クロロ-3-[(プロパノイルアミノ)メチル]-4-(トリフルオロメトキシ)安息香酸(275mg、0.844mmol)、1-メチルテトラゾール-5-アミン(100mg、1.009mmol)を3-メチルピリジン(3mL)中において窒素雰囲気

50

気下で10分間攪拌した。この反応混合物にトリエチルアミン(0.18 mL、1.3 mmol)、続いて1-メチルイミダゾール(0.075 mL、0.93 mmol)を添加し、室温で30分間攪拌した。次いで、反応混合物を0℃に冷却し、塩化チオニル(0.124 mL、1.69 mmol)を、温度が0℃で維持される量で滴下した。反応混合物を室温に温め、16時間攪拌した。反応塊を2N HCl(10 mL)で失活させ、30分間攪拌した。これを酢酸エチルで2回抽出し、組み合わせた有機物を回収し、減圧中で濃縮した。粗生成物を逆相クロマトグラフィ(水中のアセトニトリルの30~60%勾配)によって精製した。画分を含有する生成物を組み合わせ、溶剤を凍結乾燥機で除去して、2-クロロ-N-(1-メチルテトラゾール-5-イル)-3-[(プロパノイルアミノ)メチル]-4-(トリフルオロメトキシ)ベンズアミド(150 mg、0.3680 mmol、44%収率)の調製物を白色の固体として得た。<sup>1</sup>H NMR(400 MHz, メタノール) ppm 1.13(t, J = 7.64 Hz, 3H) 2.14 - 2.28(m, 2H) 4.09(s, 3H) 4.59 - 4.70(m, 2H) 7.48 - 7.56(m, 1H) 7.73 - 7.80(m, 1H) 8.29(br s, 1H)。  
【0093】

10

20

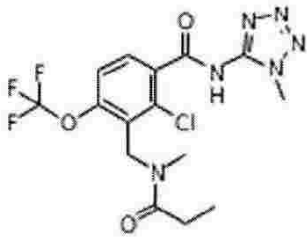
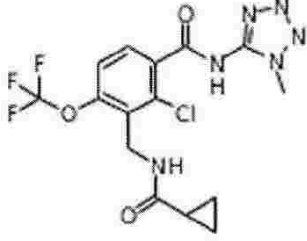
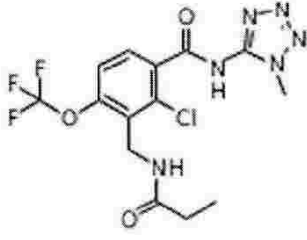
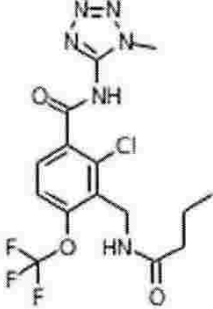
30

40

50

【表 1 - 1】

表 1-本発明の除草性化合物の例。

化合物番号	構造	<sup>1</sup> H NMR
1.001		<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, メタノール) δ ppm 1.08 – 1.23 (m, 3 H) 2.44 (q, J=7.46 Hz, 2 H) 2.66 – 2.78 (m, 1 H) 2.88 – 3.01 (m, 2 H) 4.05 – 4.15 (m, 3 H) 4.95 (s, 2 H) 7.49 – 7.62 (m, 1 H) 7.74 – 7.88 (m, 1 H) (回転異性体)
1.002		<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, メタノール) δ ppm 0.72 – 0.92 (m, 4 H) 1.48 – 1.70 (m, 1 H) 4.10 (s, 3 H) 4.60 – 4.74 (m, 2 H) 7.48 – 7.56 (m, 1 H) 7.74 – 7.81 (m, 1 H) 8.44 – 8.55 (m, 1 H)
1.003		<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, メタノール) δ ppm 1.13 (t, J=7.64 Hz, 3 H) 2.14 – 2.28 (m, 2 H) 4.09 (s, 3 H) 4.59 – 4.70 (m, 2 H) 7.48 – 7.56 (m, 1 H) 7.73 – 7.80 (m, 1 H) 8.29 (br s, 1 H)
1.004		<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, メタノール) δ: 8.21–8.33 (m, 1H), 7.75 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.44–7.54 (m, 1H), 4.57–4.69 (m, 2H), 4.07 (s, 3H), 2.16 (t, J=7.4 Hz, 2H), 1.62 (sxt, J=7.4 Hz, 2H), 0.88–0.98 (m, 3H)

10

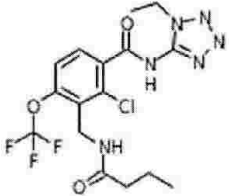
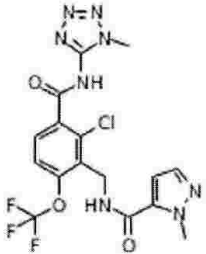
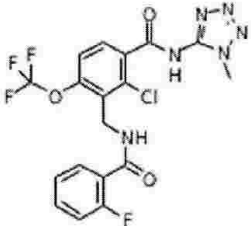
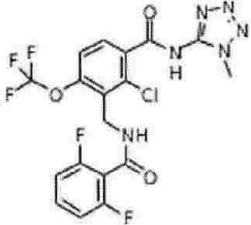
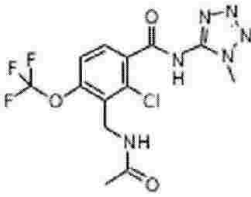
20

30

40

50

【表 1 - 2】

化合物番号	構造	<sup>1</sup> H NMR
1.005		1H NMR (400 MHz, メタノール) δ: 7.58-7.69 (m, 1H), 7.27-7.40 (m, 1H), 4.54-4.65 (m, 2H), 4.27-4.38 (m, 2H), 2.17 (t, J=7.3 Hz, 2H), 1.56-1.72 (m, 2H), 1.49 (t, J=7.3 Hz, 3H), 0.92 (t, J=7.4 Hz, 3H)
1.006		1H NMR (400 MHz, メタノール) δ = 7.80 - 7.71 (m, 1H), 7.55 - 7.49 (m, 1H), 7.43 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 6.76 - 6.73 (m, 1H), 4.80 (d, J = 5.0 Hz, 2H), 4.08 (d, J = 9.9 Hz, 6H)
1.007		1H NMR (400 MHz, メタノール) δ = 7.80 - 7.74 (m, 1H), 7.71 - 7.64 (m, 1H), 7.56 - 7.48 (m, 2H), 7.30 - 7.15 (m, 3H), 4.10 - 4.05 (m, 4H). CH2 シグナルは水のピークの下である。
1.008		1H NMR (400 MHz, メタノール) δ = 7.81 - 7.73 (m, 1H), 7.56 - 7.40 (m, 2H), 7.07 - 6.97 (m, 2H), 4.85 - 4.81 (m, 2H), 4.11 - 4.05 (m, 3H)
1.009		1H NMR (400 MHz, メタノール) δ = 7.79 - 7.73 (m, 1H), 7.54 - 7.46 (m, 1H), 4.65 - 4.61 (m, 2H), 4.07 (s, 3H), 1.97 - 1.89 (m, 3H)

10

20

30

40

50

【表 1 - 3】

化合物番号	構造	<sup>1</sup> H NMR
1.010		<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, メタノール) δ = 7.80 - 7.68 (m, 2H), 7.55 - 7.47 (m, 1H), 7.10 - 7.00 (m, 2H), 4.84 (s, 3H), 4.11 - 4.04 (m, 3H)
1.011		<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, メタノール) δ = 7.85 - 7.70 (m, 3H), 7.56 - 7.44 (m, 3H), 4.84 (s, 2H), 4.11 - 4.05 (m, 3H)
1.012		<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, メタノール) δ = 7.75 - 7.68 (m, 1H), 7.48 - 7.42 (m, 1H), 4.66 - 4.62 (m, 2H), 4.05 - 3.97 (m, 3H), 3.66 - 3.57 (m, 2H), 2.47 - 2.38 (m, 2H)
1.013		<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, メタノール) δ = 7.83 - 7.72 (m, 1H), 7.52 (br d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.86 - 4.79 (m, 3H), 4.07 (s, 3H), 3.72 (br s, 3H), 2.83 - 2.73 (m, 3H)

10

20

30

40

## 【0094】

## 生物学的実施例

ポット中の標準的な土壤中に多様なテスト種の種子を播種する（アオゲイトウ（*Amaranthus retroflexus*）（AMARE）、イチビ（*Abutilon theophrasti*）（ABUTH）、アキノエノコログサ（*Setaria faberi*）（SETFA）、イヌビエ（*Echinochloa crus-galli*）（ECHCG）、アメリカアサガオ（*Ipomoea hederacea*）（IPOHE））。温室中において、制御された条件下（24/16、昼/夜；14時間の明かり；65%湿度）で1日栽培した後（発芽前）又は8日間栽培した後（発芽後）、これら

50

の植物に、0.5%のTween 20（モノラウリン酸ポリオキシエチレンソルビタン、CAS RN 9005-64-5）を含有するアセトン/水（50：50）溶液中の技術的有効成分の配合物から得られる噴霧水溶液を噴霧する。別段の定めがある場合を除き、化合物は250g/hで適用する。次いで、テスト植物を、温室中において、制御された温室中の条件下（24/16、昼/夜；14時間の明かり；65%湿度）で1日2回水を与えて栽培する。13日後、発芽前及び発芽後について、植物に生じた損傷割合についてテストを評価する。生物学的活性を以下の表において5点のスケール（5 = 80 ~ 100%；4 = 60 ~ 79%；3 = 40 ~ 59%；2 = 20 ~ 39%；1 = 0 ~ 19%）で示す。

【0095】

【表2】

10

表 B1

化合物	後適用					前適用				
	AMAR E	ABU TH	SETF A	ECH CG	IPOH E	AMAR E	ABU TH	SETF A	ECH CG	IPOH E
1.001	5	5	5	5	5	5	5	3	4	1
1.002	5	5	5	5	5	1	3	2	2	1
1.003	5	-	5	5	5	5	5	4	1	3
1.004	5	5	5	5	5	5	5	3	1	2
1.005	5	5	5	-	5	5	5	1	1	1
1.006	5	5	5	5	5	5	5	5	5	2
1.008	-	5	4	5	5	5	5	2	2	1
1.009	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4
1.010	5	5	5	5	5	5	5	1	1	1
1.011	5	5	2	5	5	5	5	1	1	1
1.013	5	5	5	5	5	5	5	4	5	1

20

30

40

50

## 【 国際調査報告 】

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No <b>PCT/EP2022/078501</b>
--

<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b> <b>INV. C07D257/06 A01N43/713 C07D403/12</b> <b>ADD.</b>  According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
<b>B. FIELDS SEARCHED</b> Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) <b>C07D A01N</b>		
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) <b>EPO-Internal, CHEM ABS Data</b>		
<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
<b>X</b>	<b>WO 2012/028579 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; BRAUN RALF [DE] ET AL.)</b> <b>8 March 2012 (2012-03-08)</b> <b>cited in the application</b> <b>examples</b> <b>claims</b> <b>page 139; examples 4-689</b> -----	<b>1-15</b>
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C.		
<input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents :		
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier 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	
<b>8 December 2022</b>	<b>16/12/2022</b>	
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5618 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Authorized officer  <b>Stix-Malaun, Elke</b>	

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

10

20

30

40

1

50

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International application No

**PCT/EP2022/078501**

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
<b>WO 2012028579 A1</b>	<b>08-03-2012</b>	<b>AR 082828 A1</b>	<b>09-01-2013</b>
		<b>AU 2011298424 A1</b>	<b>21-03-2013</b>
		<b>BR 112013005070 A2</b>	<b>26-04-2016</b>
		<b>CA 2809487 A1</b>	<b>08-03-2012</b>
		<b>CN 103282354 A</b>	<b>04-09-2013</b>
		<b>CO 6670599 A2</b>	<b>15-05-2013</b>
		<b>DK 2611785 T3</b>	<b>25-08-2014</b>
		<b>EA 201390265 A1</b>	<b>30-08-2013</b>
		<b>EP 2611785 A1</b>	<b>10-07-2013</b>
		<b>ES 2503815 T3</b>	<b>07-10-2014</b>
		<b>HR P20140779 T1</b>	<b>07-11-2014</b>
		<b>IL 224757 A</b>	<b>30-06-2015</b>
		<b>JP 5805767 B2</b>	<b>10-11-2015</b>
		<b>JP 2013536817 A</b>	<b>26-09-2013</b>
		<b>KR 20130101506 A</b>	<b>13-09-2013</b>
		<b>MX 339739 B</b>	<b>07-06-2016</b>
		<b>MY 162780 A</b>	<b>14-07-2017</b>
		<b>PL 2611785 T3</b>	<b>31-10-2014</b>
		<b>PT 2611785 E</b>	<b>09-09-2014</b>
		<b>TW 201221059 A</b>	<b>01-06-2012</b>
		<b>UA 109150 C2</b>	<b>27-07-2015</b>
		<b>US 2012058892 A1</b>	<b>08-03-2012</b>
		<b>UY 33583 A</b>	<b>30-03-2012</b>
		<b>WO 2012028579 A1</b>	<b>08-03-2012</b>
		<b>ZA 201302334 B</b>	<b>25-09-2014</b>

10

20

30

40

50

## フロントページの続き

(51)国際特許分類

A 0 1 N 53/12 (2006.01)

F I

A 0 1 N 53/12

テーマコード (参考)

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,N  
 E,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,J  
 M,JO,JP,KE,KG,KH,KN,KP,KR,KW,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,MY  
 ,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,ST,SV,SY,T  
 H,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 . T W E E N

(74)代理人 100212509

弁理士 太田 知子

(72)発明者 アームストロング サラ

イギリス アールジー 4 2 6 イーワイ バークシャー ブラックネル シンジェンタ ジーローズ 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 パートン ポール マシュー

イギリス アールジー 4 2 6 イーワイ バークシャー ブラックネル シンジェンタ ジーローズ 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 BA03 BB11 BB13 BB15 DA13