

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2009-67739

(P2009-67739A)

(43) 公開日 平成21年4月2日(2009.4.2)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
<b>AO1N 43/58</b> (2006.01)	AO1N 43/58	B 4H011
<b>AO1N 47/34</b> (2006.01)	AO1N 47/34	E
<b>CO7D 237/16</b> (2006.01)	CO7D 237/16	

審査請求 未請求 請求項の数 12 O L (全 46 頁)

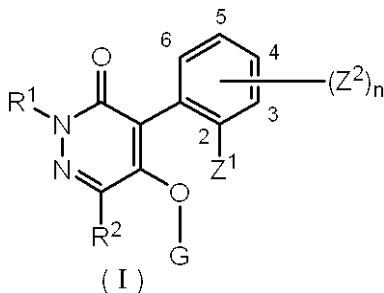
(21) 出願番号	特願2007-239158 (P2007-239158)	(71) 出願人	000002093 住友化学株式会社 東京都中央区新川二丁目27番1号
(22) 出願日	平成19年9月14日 (2007.9.14)	(74) 代理人	100113000 弁理士 中山 亨
		(72) 発明者	大和 誠司 兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内
		Fターム(参考)	4H011 AB01 BA06 BB09 BB14 BC07 BC18 BC19 BC20 DA02 DA14 DA15 DD03 DD04 DH03 DH10

(54) 【発明の名称】 除草用組成物

(57) 【要約】

【課題】優れた雑草防除効果を有する除草用組成物を提供することを課題とする。

【解決手段】一般式(I)〔式中、 $R^1$ は $C_{1-6}$ アルキル基又は( $C_{1-6}$ アルキルオキシ) $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $R^2$ は水素原子又は $C_{1-6}$ アルキル基を表し、Gは水素原子等を表し、 $Z^1$ は $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $Z^2$ は $C_{1-6}$ アルキル基を表し、nは0、1、2、3又は4を表し、nが2以上の整数を表す場合、各々の $Z^2$ は同一又は異なっていてもよい。但し、 $Z^1$ 及びn個の $Z^2$ で表される基における炭素原子数の合計は2以上である。〕で示されるピリダジノン化合物と特定の除草剤とを含有することを特徴とする除草用組成物。

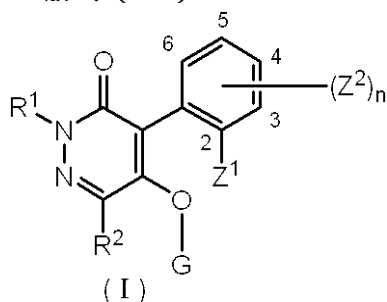


【選択図】なし

## 【特許請求の範囲】

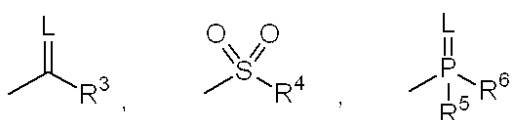
## 【請求項 1】

一般式 (I)



10

〔式中、 $R^1$ は $C_{1-6}$ アルキル基又は( $C_{1-6}$ アルキルオキシ) $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $R^2$ は水素原子又は $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $G$ は水素原子又は下記式



{ 式中、 $L$ は酸素原子又はイオウ原子を表し、

$R^3$ は $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-8}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-10}$ アリール基、( $C_{6-10}$ アリール) $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルキルオキシ基、 $C_{3-8}$ シクロアルキルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{6-10}$ アリールオキシ基、( $C_{6-10}$ アリール) $C_{1-6}$ アルキルオキシ基、アミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基、 $C_{6-10}$ アリールアミノ基、ジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノ基、ジ( $C_{2-6}$ アルケニル)アミノ基、( $C_{1-6}$ アルキル)( $C_{6-10}$ アリール)アミノ基又は3~8員の含窒素複素環基を表し、

20

$R^4$ は $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{6-10}$ アリール基、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ基又はジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノ基を表し、

$R^5$ 及び $R^6$ は同一又は異なってもよく、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-8}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{6-10}$ アリール基、 $C_{1-6}$ アルキルオキシ基、 $C_{3-8}$ シクロアルキルオキシ基、 $C_{6-10}$ アリールオキシ基、( $C_{6-10}$ アリール) $C_{1-6}$ アルキルオキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ基又はジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノ基を表す。

30

但し、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 及び $R^6$ で表されるいずれの基もハロゲン原子により置換されていてもよく、 $C_{3-8}$ シクロアルキル基、 $C_{6-10}$ アリール基、( $C_{6-10}$ アリール) $C_{1-6}$ アルキル基のアリール部分、 $C_{3-8}$ シクロアルキルオキシ基、 $C_{6-10}$ アリールオキシ基、( $C_{6-10}$ アリール) $C_{1-6}$ アルキルオキシ基のアリール部分、 $C_{6-10}$ アリールアミノ基のアリール部分、( $C_{1-6}$ アルキル)( $C_{6-10}$ アリール)アミノ基のアリール部分及び3~8員の含窒素複素環基は $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい。}

で表されるいずれかの基を表し、

$Z^1$ は $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $Z^2$ は $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $n$ は0、1、2、3又は4

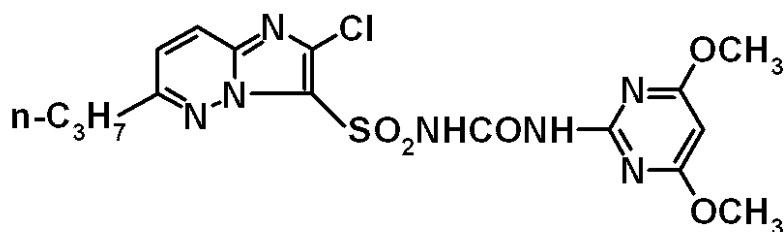
40

を表し、 $n$ が2以上の整数を表す場合、各々の $Z^2$ は同一又は異なってもよい。

但し、 $Z^1$ 及び $n$ 個の $Z^2$ で表される基における炭素原子数の合計は2以上である。}

で示されるピリダジノン化合物と、

式 (B)



## (B)

で表される化合物とを有効成分として含有することを特徴とする除草用組成物。

## 【請求項2】

10

一般式(I)のnが1以上の整数である請求項1記載の除草用組成物。

## 【請求項3】

一般式(I)のnが0であり、Z<sup>1</sup>がC<sub>2-6</sub>アルキル基である請求項1記載の除草用組成物。

## 【請求項4】

一般式(I)のnが1又は2であり、Z<sup>2</sup>の結合位置がベンゼン環上の4位及び/又は6位である請求項1記載の除草用組成物。

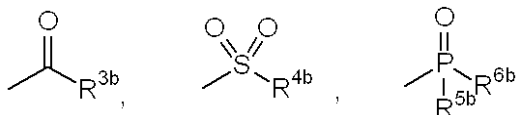
## 【請求項5】

一般式(I)のZ<sup>1</sup>がC<sub>1-3</sub>アルキル基であり、Z<sup>2</sup>がC<sub>1-3</sub>アルキル基である請求項1、2又は4記載の除草用組成物。

20

## 【請求項6】

一般式(I)のGが水素原子又は下記式



〔式中、R<sup>3b</sup>はC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル基、C<sub>6-10</sub>アリール基、(C<sub>6-10</sub>アリール)C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>アルキルオキシ基、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルオキシ基、C<sub>6-10</sub>アリールオキシ基、(C<sub>6-10</sub>アリール)C<sub>1-6</sub>アルキルオキシ基、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>6-10</sub>アリールアミノ基又はジ(C<sub>1-6</sub>アルキル)アミノ基を表し、

30

R<sup>4b</sup>はC<sub>1-6</sub>アルキル基又はC<sub>6-10</sub>アリール基を表し、

R<sup>5b</sup>及びR<sup>6b</sup>は同一又は異なってもよく、C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>アルキルオキシ基、C<sub>6-10</sub>アリールオキシ基又はC<sub>1-6</sub>アルキルチオ基を表す。

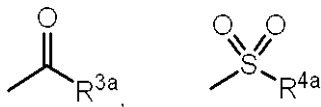
但し、R<sup>3b</sup>、R<sup>4b</sup>、R<sup>5b</sup>及びR<sup>6b</sup>で表されるいずれの基もハロゲン原子により置換されていてもよく、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル基、C<sub>6-10</sub>アリール基、(C<sub>6-10</sub>アリール)C<sub>1-6</sub>アルキル基のアリール部分、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルオキシ基、C<sub>6-10</sub>アリールオキシ基、(C<sub>6-10</sub>アリール)C<sub>1-6</sub>アルキルオキシ基のアリール部分、C<sub>6-10</sub>アリールアミノ基のアリール部分はC<sub>1-6</sub>アルキル基により置換されていてもよい。〕

で表されるいずれかの基である請求項1～5のいずれか記載の除草用組成物。

40

## 【請求項7】

一般式(I)のGが水素原子又は下記式



〔式中、R<sup>3a</sup>はC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル基、C<sub>6-10</sub>アリール基、C<sub>1-6</sub>アルキルオキシ基又はジ(C<sub>1-6</sub>アルキル)アミノ基を表し、

R<sup>4a</sup>はC<sub>1-6</sub>アルキル基を表す。

但し、R<sup>3a</sup>及びR<sup>4a</sup>で表されるいずれの基もハロゲン原子により置換されていてもよく、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル基及びC<sub>6-10</sub>アリール基はC<sub>1-6</sub>アルキル基により置換されていても

50

よい。]

で表されるいずれかの基である請求項 1 ~ 5 のいずれか記載の除草用組成物。

【請求項 8】

一般式 (I) の  $R^2$  が水素原子又は  $C_{1-3}$  アルキル基である請求項 1 ~ 7 のいずれか記載の除草用組成物。

【請求項 9】

一般式 (I) の  $R^2$  が水素原子又はメチル基である請求項 1 ~ 7 のいずれか記載の除草用組成物。

【請求項 10】

一般式 (I) の  $R^1$  が  $C_{1-3}$  アルキル基又は ( $C_{1-3}$  アルキルオキシ)  $C_{1-3}$  アルキル基である請求項 1 ~ 9 のいずれか記載の除草用組成物。 10

【請求項 11】

請求項 1 ~ 10 のいずれか記載のピリダジノン化合物の有効量と、式 (B) で表される化合物の有効量とを、同時に若しくは別々に、雑草又は雑草の生育する土壤に施用する雑草の防除方法。

【請求項 12】

請求項 1 ~ 10 のいずれか記載のピリダジノン化合物と式 (B) で表される化合物との雑草防除のための使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

20

【0001】

本発明は、除草用組成物等に関する。

【背景技術】

【0002】

現在、数多くの除草剤が市販され、使用されている(例えば、非特許文献 1 参照)が、除草効果の点でさらに多様な除草用組成物が求められている。

【0003】

【非特許文献 1】ペスティサイドマニュアル (The Pesticide Manual) Thirteenth Edition (2003)、British Crop Protection Council (I S B N : 1 - 9 0 1 3 9 6 - 1 3 - 4 ) 30

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

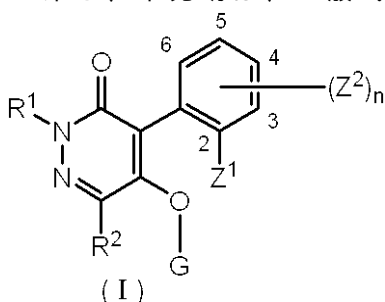
本発明は優れた雑草防除効果を有する除草用組成物を提供することを課題とする。

【課題を解決するための手段】

【0005】

本発明者等は、鋭意検討した結果、一般式 (I) で表されるピリダジノン化合物と式 (B) で表される化合物とを有効成分として含有する除草用組成物が、雑草に茎葉処理又は土壤処理することにより、優れた雑草防除の効果を示すことを見出し、本発明に至った。 40

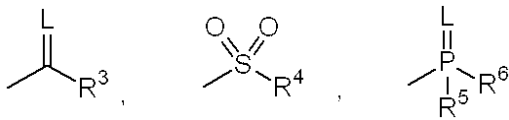
即ち、本発明は、一般式 (I)



〔式中、 $R^1$  は  $C_{1-6}$  アルキル基又は ( $C_{1-6}$  アルキルオキシ)  $C_{1-6}$  アルキル基を表し、

50

$R^2$  は水素原子又は  $C_{1-6}$  アルキル基を表し、  
 $G$  は水素原子又は下記式



{ 式中、 $L$  は酸素原子又はイオウ原子を表し、

$R^3$  は  $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{3-8}$  シクロアルキル基、 $C_{2-6}$  アルケニル基、 $C_{2-6}$  アルキニル基、 $C_{6-10}$  アリール基、( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルキルオキシ基、 $C_{3-8}$  シクロアルキルオキシ基、 $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$  アルキニルオキシ基、 $C_{6-10}$  アリールオキシ基、( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキルオキシ基、アミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、 $C_{2-6}$  アルケニルアミノ基、 $C_{6-10}$  アリールアミノ基、ジ( $C_{1-6}$  アルキル)アミノ基、ジ( $C_{2-6}$  アルケニル)アミノ基、( $C_{1-6}$  アルキル)( $C_{6-10}$  アリール)アミノ基又は 3 ~ 8 員の含窒素複素環基を表し、

$R^4$  は  $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{6-10}$  アリール基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基又はジ( $C_{1-6}$  アルキル)アミノ基を表し、

$R^5$  及び  $R^6$  は同一又は異なってもよく、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{3-8}$  シクロアルキル基、 $C_{2-6}$  アルケニル基、 $C_{6-10}$  アリール基、 $C_{1-6}$  アルキルオキシ基、 $C_{3-8}$  シクロアルキルオキシ基、 $C_{6-10}$  アリールオキシ基、( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキルオキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルチオ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基又はジ( $C_{1-6}$  アルキル)アミノ基を表す。

但し、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  及び  $R^6$  で表されるいずれの基もハロゲン原子により置換されていてもよく、 $C_{3-8}$  シクロアルキル基、 $C_{6-10}$  アリール基、( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキル基のアリール部分、 $C_{3-8}$  シクロアルキルオキシ基、 $C_{6-10}$  アリールオキシ基、( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキルオキシ基のアリール部分、 $C_{6-10}$  アリールアミノ基のアリール部分、( $C_{1-6}$  アルキル)( $C_{6-10}$  アリール)アミノ基のアリール部分及び 3 ~ 8 員の含窒素複素環基は  $C_{1-6}$  アルキル基により置換されていてもよい。}

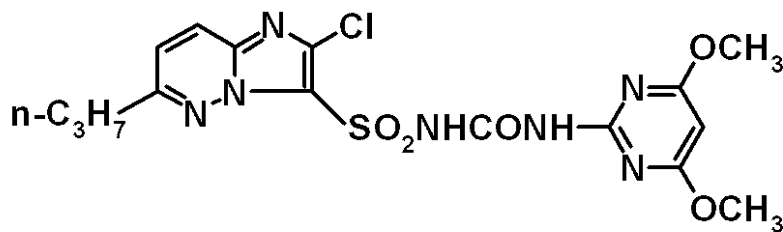
で表されるいずれかの基を表し、

$Z^1$  は  $C_{1-6}$  アルキル基を表し、 $Z^2$  は  $C_{1-6}$  アルキル基を表し、 $n$  は 0、1、2、3 又は 4 を表し、 $n$  が 2 以上の整数を表す場合、各々の  $Z^2$  は同一又は異なってもよい。

但し、 $Z^1$  及び  $n$  個の  $Z^2$  で表される基における炭素原子数の合計は 2 以上である。}

で示されるピリダジノン化合物(以下、本化合物と記すことがある。)と、

式(B)



(B)

で表される化合物(以下、化合物Bと記すことがある。)とを有効成分として含有する除草用組成物(以下、本発明除草用組成物と記すことがある。)等を提供する。

【発明の効果】

【0006】

本発明により、優れた雑草防除効果を有する除草用組成物が提供可能になる。

【発明を実施するための最良の形態】

【0007】

本発明除草用組成物の有効成分として用いられる一般式(I)の化合物の  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $Z^1$  及び  $Z^2$  で表される置換基において、

10

20

30

40

50

$C_{1-6}$ アルキル基とは、炭素原子数 1 ~ 6 のアルキル基を意味し、例えば、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、ペンチル基、*sec*-ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、ヘキシル基、イソヘキシル基等が挙げられ、

$C_{3-8}$ シクロアルキル基とは、炭素原子数 3 ~ 8 のシクロアルキル基を意味し、例えば、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等が挙げられ、

$C_{2-6}$ アルケニル基とは、炭素原子数 2 ~ 6 のアルケニル基を意味し、例えば、アリル基、1-ブテン-3-イル基、3-ブテン-1-イル基等が挙げられ、

$C_{2-6}$ アルキニル基とは、炭素原子数 2 ~ 6 のアルキニル基を意味し、例えば、プロパルギル基、2-ブチニル基等が挙げられ、

$C_{6-10}$ アリール基とは、炭素原子数 6 ~ 10 のアリール基を意味し、例えば、フェニル基、ナフチル基等が挙げられ、

( $C_{6-10}$ アリール) $C_{1-6}$ アルキル基とは、 $C_{6-10}$ アリール基で置換された $C_{1-6}$ アルキル基を意味し、例えば、ベンジル基、フェネチル基等が挙げられ、

$C_{1-6}$ アルキルオキシ基とは、炭素原子数 1 ~ 6 のアルキルオキシ基を意味し、例えば、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基等が挙げられ、

$C_{3-8}$ シクロアルキルオキシ基とは、炭素原子数 3 ~ 8 のシクロアルキルオキシ基を意味し、例えば、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基等が挙げられ、

$C_{2-6}$ アルケニルオキシ基とは、炭素原子数 2 ~ 6 のアルケニルオキシ基を意味し、例えば、ビニルオキシ基、アリルオキシ基等が挙げられ、

$C_{2-6}$ アルキニルオキシ基とは、炭素原子数 2 ~ 6 のアルキニルオキシ基を意味し、例えば、プロパルギルオキシ基、2-ブチニルオキシ基等が挙げられ、

$C_{6-10}$ アリールオキシ基とは、炭素原子数 6 ~ 10 のアリールオキシ基を意味し、例えば、フェノキシ基、ナフチルオキシ基等が挙げられ、

( $C_{6-10}$ アリール) $C_{1-6}$ アルキルオキシ基とは、 $C_{6-10}$ アリール基で置換された $C_{1-6}$ アルキルオキシ基を意味し、例えば、ベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基等が挙げられ、

$C_{1-6}$ アルキルアミノ基とは、炭素原子数 1 ~ 6 のアルキルアミノ基を意味し、例えば、メチルアミノ基、エチルアミノ基等が挙げられ、

$C_{2-6}$ アルケニルアミノ基とは、炭素原子数 2 ~ 6 のアルケニルアミノ基を意味し、例えば、アリルアミノ基、3-ブテニルアミノ基等が挙げられ、

$C_{6-10}$ アリールアミノ基とは、炭素原子数 6 ~ 10 のアリールアミノ基を意味し、例えば、フェニルアミノ基、ナフチルアミノ基等が挙げられ、

ジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノ基とは、2つの同一又は異なった $C_{1-6}$ アルキル基で置換されたアミノ基を意味し、例えば、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、*N*-エチル-*N*-メチルアミノ基等が挙げられ、

ジ( $C_{2-6}$ アルケニル)アミノ基とは、2つの同一又は異なった $C_{2-6}$ アルケニル基で置換されたアミノ基を意味し、例えば、ジアリルアミノ基、ジ(3-ブテニル)アミノ基等が挙げられ、

( $C_{1-6}$ アルキル)( $C_{6-10}$ アリール)アミノ基とは、 $C_{1-6}$ アルキル基及び $C_{6-10}$ アリール基で置換されたアミノ基を意味し、例えば、メチルフェニルアミノ基、エチルフェニルアミノ基等が挙げられ、

$C_{1-6}$ アルキルチオ基とは、炭素原子数 1 ~ 6 のアルキルチオ基を意味し、例えば、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基等が挙げられ、

( $C_{1-6}$ アルキルオキシ) $C_{1-6}$ アルキル基とは、 $C_{1-6}$ アルキルオキシ基で置換された $C_{1-6}$ アルキル基を意味し、例えば、メトキシエチル基、エトキシエチル基等が挙げられ、

3 ~ 8 員の含窒素複素環基とは、1 ~ 3 個の窒素原子を含み、更に 1 ~ 3 個の酸素原子及び/又はイオウ原子を含んでいてもよく、芳香族又は脂環式の 3 ~ 8 員の複素環基を意味し、例えば、1-ピラゾリル基、2-ピリジル基、2-ピリミジニル基、2-チアゾリル基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基等が挙げられる。

10

20

30

40

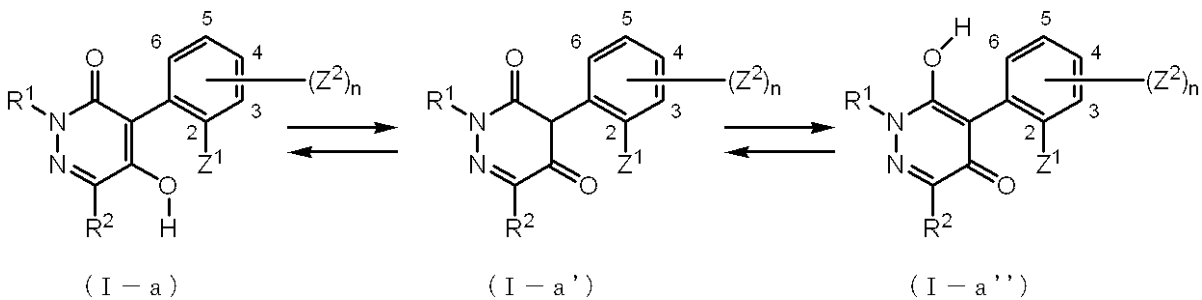
50

$R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 及び $R^6$ で表される基が置換されていてもよいハロゲン原子としては、例えば、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等が挙げられる。

$R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 及び $R^6$ で表される基における、 $C_{3-8}$ シクロアルキル基、 $C_{6-10}$ アリール基、( $C_{6-10}$ アリール) $C_{1-6}$ アルキル基のアリール部分、 $C_{3-8}$ シクロアルキルオキシ基、 $C_{6-10}$ アリールオキシ基、( $C_{6-10}$ アリール) $C_{1-6}$ アルキルオキシ基のアリール部分、 $C_{6-10}$ アリールアミノ基のアリール部分、( $C_{1-6}$ アルキル)( $C_{6-10}$ アリール)アミノ基のアリール部分及び3~8員の含窒素複素環基が置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基としては、例えば、メチル基、エチル基、プロピル基、ブチル基等が挙げられる。

【0008】

本発明除草用組成物の有効成分として用いられる一般式(I)の化合物のうち、Gが水素原子である一般式(I-a)で示される化合物は、一般式(I-a')及び一般式(I-a'')で示される互変異性体が存在し得る。一般式(I-a)で示される化合物には、これらの互変異性体のすべて及びそれらのうちの任意の2個以上からなる混合物が含まれる。



【0009】

また、本発明除草用組成物の有効成分として用いられる一般式(I-a)で示される化合物には、無機塩基(例えば、アルカリ金属(リチウム、ナトリウム、カリウム等)の水酸化物、炭酸塩、炭酸水素塩、酢酸塩、水素化物等、アルカリ土類金属(マグネシウム、カルシウム、バリウム等)の水酸化物、水素化物等、アンモニア)、有機塩基(例えば、ジメチルアミン、トリエチルアミン、ピペラジン、ピロリジン、ペペリジン、2-フェニルエチルアミン、ベンジルアミン、エタノールアミン、ジエタノールアミン、ピリジン、コリジン等)、金属アルコキシド(例えば、ナトリウムメトキシド、カリウムtert-ブトキシド、マグネシウムメトキシド等)等と一般式(I-a)で示される化合物とが混合された塩等の農学的に許容される塩が含まれる。

【0010】

本化合物が1個以上の不斉中心を有する場合、該化合物には2個以上の立体異性体(例えば、エナンチオマー、ジアステレオマー等)が存在する。一般式(I)の化合物には、これらの立体異性体のすべて及びそれらのうちの任意の2個以上からなる混合物が含まれる。

また本化合物が二重結合等に基づく幾何異性を有する場合、該化合物には2個以上の幾何異性体(例えば、E/Z又はトランス/シスの各異性体、S-トランス/S-シスの各異性体等)が存在する。本化合物には、これらの幾何異性体のすべて及びそれらのうちの任意の2個以上からなる混合物が含まれる。

【0011】

本発明除草用組成物の有効成分として用いられる本化合物の好ましい態様としては、例えば、以下に示される態様が挙げられる。

一般式(I)において、nが1以上の整数であるピリダジノン化合物。

一般式(I)において、nが0であり、 $Z^1$ が $C_{2-6}$ アルキル基であるピリダジノン化合物。

一般式(I)において、nが1又は2であり、 $Z^2$ の結合位置がベンゼン環上の4位及び/又は6位であるピリダジノン化合物。

一般式(I)において、Gが水素原子又は下記式

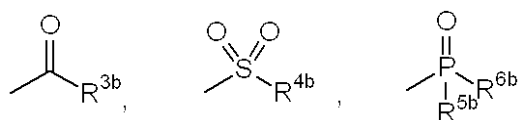
10

20

30

40

50



{ 式中、 $R^{3b}$ は $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-8}$ シクロアルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{6-10}$ アリール基、( $C_{6-10}$ アリール) $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルキルオキシ基、 $C_{3-8}$ シクロアルキルオキシ基、 $C_{6-10}$ アリールオキシ基、( $C_{6-10}$ アリール) $C_{1-6}$ アルキルオキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、 $C_{6-10}$ アリールアミノ基又はジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノ基を表し、

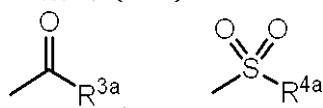
$R^{4b}$ は $C_{1-6}$ アルキル基又は $C_{6-10}$ アリール基を表し、

$R^{5b}$ 及び $R^{6b}$ は同一又は異なってもよく、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルキルオキシ基、 $C_{6-10}$ アリールオキシ基又は $C_{1-6}$ アルキルチオ基を表す。

但し、 $R^{3b}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^{5b}$ 及び $R^{6b}$ で表されるいずれの基もハロゲン原子により置換されていてもよく、 $C_{3-8}$ シクロアルキル基、 $C_{6-10}$ アリール基、( $C_{6-10}$ アリール) $C_{1-6}$ アルキル基のアリール部分、 $C_{3-8}$ シクロアルキルオキシ基、 $C_{6-10}$ アリールオキシ基、( $C_{6-10}$ アリール) $C_{1-6}$ アルキルオキシ基のアリール部分、 $C_{6-10}$ アリールアミノ基のアリール部分は $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい。}

で表されるいずれかの基であるピリダジノン化合物。

一般式 (I) において、G が水素原子又は下記式



{ 式中、 $R^{3a}$ は $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{3-8}$ シクロアルキル基、 $C_{6-10}$ アリール基、 $C_{1-6}$ アルキルオキシ基又はジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノ基を表し、

$R^{4a}$ は $C_{1-6}$ アルキル基を表す。

但し、 $R^{3a}$ 及び $R^{4a}$ で表されるいずれの基もハロゲン原子により置換されていてもよく、 $C_{3-8}$ シクロアルキル基及び $C_{6-10}$ アリール基は $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい。}

で表されるいずれかの基であるピリダジノン化合物。

一般式 (I) において、 $R^1$ が $C_{1-3}$ アルキル基又は( $C_{1-3}$ アルキルオキシ) $C_{1-3}$ アルキル基であるピリダジノン化合物。

一般式 (I) において、 $R^2$ が水素原子又は $C_{1-3}$ アルキル基であるピリダジノン化合物。

一般式 (I) において、 $R^2$ が水素原子又はメチル基であるピリダジノン化合物。

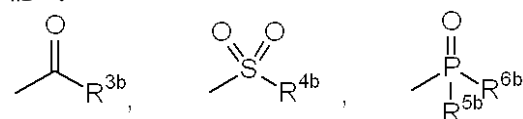
一般式 (I) において、 $Z^1$ が $C_{1-3}$ アルキル基であり、 $Z^2$ が $C_{1-3}$ アルキル基であるピリダジノン化合物。

#### 【0012】

一般式 (I) において、 $R^1$ が $C_{1-3}$ アルキル基又は( $C_{1-3}$ アルキルオキシ) $C_{1-3}$ アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子又は $C_{1-3}$ アルキル基であるピリダジノン化合物。

一般式 (I) において、 $R^1$ が $C_{1-3}$ アルキル基又は( $C_{1-3}$ アルキルオキシ) $C_{1-3}$ アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子又はメチル基であるピリダジノン化合物。

一般式 (I) において、 $R^2$ が水素原子又は $C_{1-3}$ アルキル基であり、G が水素原子又は下記式



{ 式中、 $R^{3b}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^{5b}$ 及び $R^{6b}$ は前記と同じ意味を表す。}

で表されるいずれかの基であるピリダジノン化合物。

一般式 (I) において、 $R^2$ が水素原子又は $C_{1-3}$ アルキル基であり、G が水素原子又は下記式

10

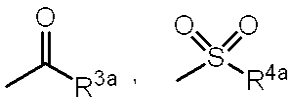
20

30

40

50

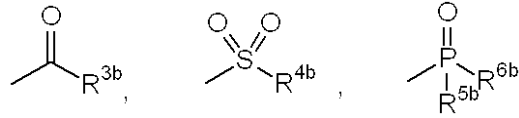




{ 式中、 $R^{3a}$  及び  $R^{4a}$  は前記と同じ意味を表す。 }

で表されるいずれかの基であるピリダジノン化合物。

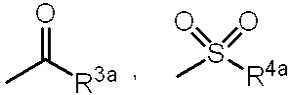
一般式 (I) において、 $R^2$  が水素原子又はメチル基であり、 $G$  が水素原子又は下記式



{ 式中、 $R^{3b}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^{5b}$  及び  $R^{6b}$  は前記と同じ意味を表す。 }

で表されるいずれかの基であるピリダジノン化合物。

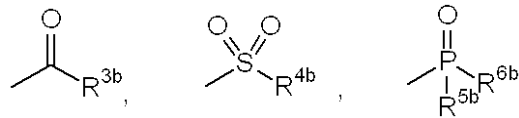
一般式 (I) において、 $R^2$  が水素原子又はメチル基であり、 $G$  が水素原子又は下記式



{ 式中、 $R^{3a}$  及び  $R^{4a}$  は前記と同じ意味を表す。 }

で表されるいずれかの基であるピリダジノン化合物。

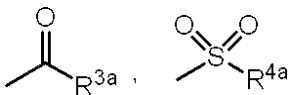
一般式 (I) において、 $R^1$  が  $C_{1-3}$  アルキル基又は ( $C_{1-3}$  アルキルオキシ)  $C_{1-3}$  アルキル基であり、 $R^2$  が水素原子又は  $C_{1-3}$  アルキル基であり、 $G$  が水素原子又は下記式



{ 式中、 $R^{3b}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^{5b}$  及び  $R^{6b}$  は前記と同じ意味を表す。 }

で表されるいずれかの基であるピリダジノン化合物。

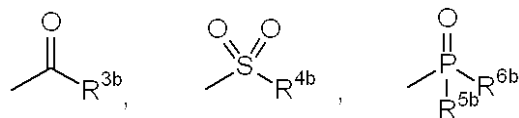
一般式 (I) において、 $R^1$  が  $C_{1-3}$  アルキル基又は ( $C_{1-3}$  アルキルオキシ)  $C_{1-3}$  アルキル基であり、 $R^2$  が水素原子又は  $C_{1-3}$  アルキル基であり、 $G$  が水素原子又は下記式



{ 式中、 $R^{3a}$  及び  $R^{4a}$  は前記と同じ意味を表す。 }

で表されるいずれかの基であるピリダジノン化合物。

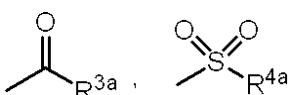
一般式 (I) において、 $R^1$  が  $C_{1-3}$  アルキル基又は ( $C_{1-3}$  アルキルオキシ)  $C_{1-3}$  アルキル基であり、 $R^2$  が水素原子又はメチル基であり、 $G$  が水素原子又は下記式



{ 式中、 $R^{3b}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^{5b}$  及び  $R^{6b}$  は前記と同じ意味を表す。 }

で表されるいずれかの基であるピリダジノン化合物。

一般式 (I) において、 $R^1$  が  $C_{1-3}$  アルキル基又は ( $C_{1-3}$  アルキルオキシ)  $C_{1-3}$  アルキル基であり、 $R^2$  が水素原子又はメチル基であり、 $G$  が水素原子又は下記式



{ 式中、 $R^{3a}$  及び  $R^{4a}$  は前記と同じ意味を表す。 }

で表されるいずれかの基であるピリダジノン化合物。

【 0 0 1 3 】

一般式 (I) において、 $R^1$  が  $C_{1-3}$  アルキル基又は ( $C_{1-3}$  アルキルオキシ)  $C_{1-3}$  アルキル

10

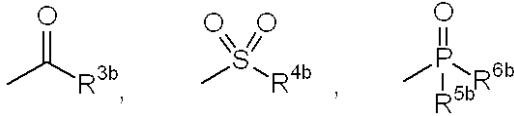
20

30

40

50

ル基であり、 $R^2$ が水素原子又は $C_{1-3}$ アルキル基であり、  
 $n$ が0、1又は2の整数を表し、 $n$ が2を表す場合、2つの $Z^2$ は同一又は異なっているもよく、 $n$ が1又は2を表す場合、 $Z^2$ の結合位置がベンゼン環上の4位及び/又は6位であり、  
 $Z^1$ が $C_{1-6}$ アルキル基（更に好ましくは $C_{1-3}$ アルキル基）であり、  
 $Z^2$ が $C_{1-6}$ アルキル基（更に好ましくは $C_{1-3}$ アルキル基）であるピリダジノン化合物。  
 一般式（I）において、 $R^1$ が $C_{1-3}$ アルキル基又は（ $C_{1-3}$ アルキルオキシ） $C_{1-3}$ アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子又は $C_{1-3}$ アルキル基であり、 $G$ が水素原子又は下記式



10

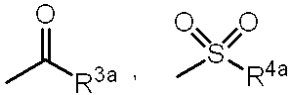
{ 式中、 $R^{3b}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^{5b}$ 及び $R^{6b}$ は前記と同じ意味を表す。 }

で表されるいずれかの基であり、

$n$ が0、1又は2の整数を表し、 $n$ が2を表す場合、2つの $Z^2$ は同一又は異なっているもよく、 $n$ が1又は2を表す場合、 $Z^2$ の結合位置がベンゼン環上の4位及び/又は6位であり、

$Z^1$ が $C_{1-6}$ アルキル基（更に好ましくは $C_{1-3}$ アルキル基）であり、  
 $Z^2$ が $C_{1-6}$ アルキル基（更に好ましくは $C_{1-3}$ アルキル基）であるピリダジノン化合物。  
 一般式（I）において、 $R^1$ が $C_{1-3}$ アルキル基又は（ $C_{1-3}$ アルキルオキシ） $C_{1-3}$ アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子又は $C_{1-3}$ アルキル基であり、 $G$ が水素原子又は下記式

20



{ 式中、 $R^{3a}$ 及び $R^{4a}$ は前記と同じ意味を表す。 }

で表されるいずれかの基であり、

$n$ が0、1又は2の整数を表し、 $n$ が2を表す場合、2つの $Z^2$ は同一又は異なっているもよく、 $n$ が1又は2を表す場合、 $Z^2$ の結合位置がベンゼン環上の4位及び/又は6位であり、

$Z^1$ が $C_{1-6}$ アルキル基（更に好ましくは $C_{1-3}$ アルキル基）であり、  
 $Z^2$ が $C_{1-6}$ アルキル基（更に好ましくは $C_{1-3}$ アルキル基）であるピリダジノン化合物。

30

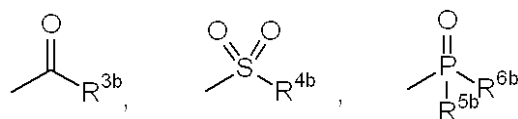
【0014】

一般式（I）において、 $R^1$ が $C_{1-3}$ アルキル基又は（ $C_{1-3}$ アルキルオキシ） $C_{1-3}$ アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子又はメチル基であり、

$n$ が0、1又は2の整数を表し、 $n$ が2を表す場合、2つの $Z^2$ は同一又は異なっているもよく、 $n$ が1又は2を表す場合、 $Z^2$ の結合位置がベンゼン環上の4位及び/又は6位であり、

$Z^1$ が $C_{1-6}$ アルキル基（更に好ましくは $C_{1-3}$ アルキル基）であり、  
 $Z^2$ が $C_{1-6}$ アルキル基（更に好ましくは $C_{1-3}$ アルキル基）であるピリダジノン化合物。  
 一般式（I）において、 $R^1$ が $C_{1-3}$ アルキル基又は（ $C_{1-3}$ アルキルオキシ） $C_{1-3}$ アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子又はメチル基であり、 $G$ が水素原子又は下記式

40



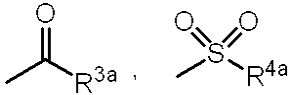
{ 式中、 $R^{3b}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^{5b}$ 及び $R^{6b}$ は前記と同じ意味を表す。 }

で表されるいずれかの基であり、

$n$ が0、1又は2の整数を表し、 $n$ が2を表す場合、2つの $Z^2$ は同一又は異なっているもよく、 $n$ が1又は2を表す場合、 $Z^2$ の結合位置がベンゼン環上の4位及び/又は6位であり、

50

$Z^1$ が $C_{1-6}$ アルキル基（更に好ましくは $C_{1-3}$ アルキル基）であり、  
 $Z^2$ が $C_{1-6}$ アルキル基（更に好ましくは $C_{1-3}$ アルキル基）であるピリダジノン化合物。  
 一般式（I）において、 $R^1$ が $C_{1-3}$ アルキル基又は（ $C_{1-3}$ アルキルオキシ） $C_{1-3}$ アルキル基であり、 $R^2$ が水素原子又はメチル基であり、 $G$ が水素原子又は下記式



{ 式中、 $R^{3a}$ 及び $R^{4a}$ は前記と同じ意味を表す。 }

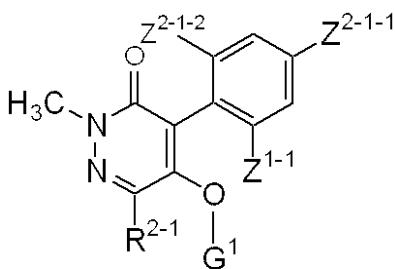
で表されるいずれかの基であり、

$n$ が0、1又は2の整数を表し、 $n$ が2を表す場合、2つの $Z^2$ は同一又は異なってもよく、 $n$ が1又は2を表す場合、 $Z^2$ の結合位置がベンゼン環上の4位及び/又は6位であり、

$Z^1$ が $C_{1-6}$ アルキル基（更に好ましくは $C_{1-3}$ アルキル基）であり、

$Z^2$ が $C_{1-6}$ アルキル基（更に好ましくは $C_{1-3}$ アルキル基）であるピリダジノン化合物。

一般式（I-1）



(I-1)

において、 $R^{2-1}$ が水素原子又は $C_{1-3}$ アルキル基であり、 $G^1$ が水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_{1-3}$ アルキルカルボニル基、 $C_{1-3}$ アルコキシカルボニル基又は $C_{6-10}$ アリアルカルボニル基であり、

$Z^{1-1}$ が $C_{1-3}$ アルキル基であり、

$Z^{2-1-1}$ が $C_{1-3}$ アルキル基であり、

$Z^{2-1-2}$ が水素原子又は $C_{1-3}$ アルキル基であるピリダジノン化合物。

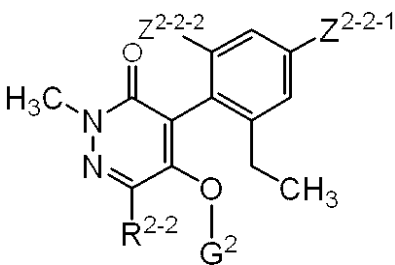
一般式（I-1）において、 $R^{2-1}$ が水素原子、メチル基又はエチル基であり、 $G^1$ が水素原子、アセチル基、プロピオニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基又はベンゾイル基であり、

$Z^{1-1}$ がメチル基又はエチル基であり、

$Z^{2-1-1}$ がメチル基又はエチル基であり、

$Z^{2-1-2}$ が水素原子、メチル基又はエチル基であるピリダジノン化合物。

一般式（I-2）



(I-2)

において、 $R^{2-2}$ が水素原子又は $C_{1-3}$ アルキル基であり、 $G^2$ が水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_{1-3}$ アルキルカルボニル基又は $C_{1-3}$ アルコキシカルボニル基であり、

$Z^{2-2-1}$ が水素原子又は $C_{1-3}$ アルキル基であり、

$Z^{2-2-2}$ が水素原子又は $C_{1-3}$ アルキル基であるピリダジノン化合物。

一般式 ( I - 2 ) において、 $R^{2-2}$  が水素原子、メチル基又はエチル基であり、 $G^2$  が水素原子、アセチル基、メトキシカルボニル基又はエトキシカルボニル基であり、 $Z^{2-2-1}$  が水素原子、メチル基又はエチル基であり、 $Z^{2-2-2}$  が水素原子、メチル基又はエチル基であるピリダジノン化合物。

【 0 0 1 5 】

化合物 B は、公知の化合物であり、例えば、特許第 3 6 8 2 2 8 8 号公報等に記載の方法により製造することができる。

【 0 0 1 6 】

本発明除草用組成物は、広範囲の雑草に対し除草活性を有し、通常の耕起栽培・不耕起栽培が行われる農作物畑、野菜畑、樹園地又は非農耕地において、効果的に広範囲の雑草を防除することができる。

本発明除草用組成物で防除できる雑草としては、例えば次のものが挙げられる。

メヒシバ、オヒシバ、エノコログサ、アキノエノコログサ、キンエノコログサ、イヌビエ、オオクサキビ、テキサスパニカム、メリケンクキビ、セイバンモロコシ、シャッターケーン、ギョウギシバ、カラスムギ、ネズミムギ、ブラックグラス、ウマノチャヒキ、アレチノチャヒキ、ヒメカナリークサヨシ、セイヨウヌカボ、スズメノカタビラ、シバムギ、コゴメガヤツリ、ハマスゲ、キハマスゲ、スベリヒユ、アオゲイトウ、ホナガアオゲイトウ、イチビ、アメリカキンゴジカ、ソバカズラ、サナエタデ、アメリカサナエタデ、ハルタデ、ナガバギシギシ、エゾノギシギシ、イタドリ、シロザ、ホウキギ、イヌタデ、イヌホオズキ、シロバナチョウセンアサガオ、マルバアサガオ、アメリカアサガオ、マルバアメリカアサガオ、マメアサガオ、セイヨウヒルガオ、ヒメオドリコソウ、ホトケノザ、オナモミ、野生ヒマワリ、イヌカミツレ、カミツレ、コーンマリーゴールド、オロシャギク、ブタクサ、オオブタクサ、ヒメムカシヨモギ、ヨモギ、セイトカアワダチソウ、アメリカツノクサネム、エビスグサ、フロリダベガーウィード、シロツメクサ、クズ、カラスノエンドウ、ツユクサ、マルバツユクサ、ヤエムグラ、ハコベ、ワイルドラディッシュ、ノハラガラシ、ナズナ、オオイヌノフグリ、フラサバソウ、フィールドパンジー、ワイルドパンジー、ヒナゲシ、ワスレナグサ、オオトウワタ、トウダイグサ、オオニシキソウ、アメリカフウロ、オランダフウロ、スギナ等の畑地雑草、タイヌビエ、ヒメタイヌビエ、タマガヤツリ、コゴメガヤツリ、ヒデリコ、マツバイ、イヌホタルイ、タイワンヤマイ、ミズガヤツリ、クログワイ、コウキヤガラ、シズイ、コナギ、アゼナ、アブノメ、キカシグサ、ヒメミソハギ、ミゾハコベ、チョウジタデ、ウリカワ、ヘラオモダカ、オモダカ、ヒルムシロ、セリ、ミズハコベ、アゼトウガラシ、アメリカアゼナ、タカサプロウ、イボクサ、キシウズズメノヒエ、エゾノサヤヌカグサ等の水田雑草。

【 0 0 1 7 】

本発明除草用組成物は、畑、水田、芝生、果樹園等の農耕地又は非農耕地用の除草剤として使用することができる。本発明除草用組成物は、以下に挙げる「作物」等を栽培する農耕地において、該作物等に対して薬害を与えることなく、当該農耕地の雑草を防除することができる場合がある。

農作物：トウモロコシ、イネ、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク、ソルガム、ワタ、ダイズ、ピーナッツ、ソバ、テンサイ、ナタネ、ヒマワリ、サトウキビ、タバコ等、

野菜：ナス科野菜（ナス、トマト、ピーマン、トウガラシ、ジャガイモ等）、ウリ科野菜（キュウリ、カボチャ、ズッキーニ、スイカ、メロン等）、アブラナ科野菜（ダイコン、カブ、セイヨウワサビ、コールラビ、ハクサイ、キャベツ、カラシナ、ブロッコリー、カリフラワー等）、キク科野菜（ゴボウ、シュンギク、アーティチョーク、レタス等）、ユリ科野菜（ネギ、タマネギ、ニンニク、アスパラガス等）、セリ科野菜（ニンジン、パセリ、セロリ、アメリカボウフウ等）、アカザ科野菜（ホウレンソウ、フダンソウ等）、シソ科野菜（シソ、ミント、バジル等）、イチゴ、サツマイモ、ヤマノイモ、サトイモ等、

花卉、  
観葉植物、

10

20

30

40

50

果樹：仁果類（リンゴ、セイヨウナシ、ニホンナシ、カリン、マルメロ等）、核果類（モモ、スモモ、ネクタリン、ウメ、オウトウ、アンズ、プルーン等）、カンキツ類（ウンシュウミカン、オレンジ、レモン、ライム、グレープフルーツ等）、堅果類（クリ、クルミ、ハシバミ、アーモンド、ピスタチオ、カシューナッツ、マカダミアナッツ等）、液果類（ブルーベリー、クランベリー、ブラックベリー、ラズベリー等）、ブドウ、カキ、オリーブ、ビワ、バナナ、コーヒー、ナツメヤシ、ココヤシ等、

果樹以外の樹；チャ、クワ、花木、街路樹（トネリコ、カバノキ、ハナミズキ、ユーカリ、イチヨウ、ライラック、カエデ、カシ、ポプラ、ハナズオウ、フウ、プラタナス、ケヤキ、クロベ、モミノキ、ツガ、ネズ、マツ、トウヒ、イチイ）等。

【0018】

上記「作物」には、イソキサフルトール等のHPPD阻害剤、イマゼタピル、チフェンスルフロメチル等のALS阻害剤、EPSP合成酵素阻害剤、グルタミン合成酵素阻害剤、アセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤、プロモキシニル、ジカンバ等の除草剤に対する耐性が、古典的な育種法、もしくは遺伝子組換え技術により付与された作物も含まれる。

古典的な育種法により耐性が付与された「作物」としては、例えば、イマゼタピル等のイミダゾリノン系除草剤耐性のクリアフィールド（Clearfield）<登録商標>カノーラ、チフェンスルフロメチル等のスルホニル尿素系ALS阻害型除草剤耐性のSTSダイズ等がある。同様に古典的な育種法によりトリオンオキシム系、アリアルオキシフェノキシプロピオン酸系除草剤などのアセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤に耐性が付与された作物の例としてSRコーン等がある。アセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤に耐性が付与された作物はプロシーディングズ・オブ・ザ・ナショナル・アカデミー・オブ・サイエンス・オブ・ザ・ユナイテッド・ステーツ・オブ・アメリカ（Proc. Natl. Acad. Sci. USA）87巻、7175～7179頁（1990年）等に記載されている。またアセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤に耐性の変異アセチルCoAカルボキシラーゼがウィード・サイエンス（Weed Science）53巻、728～746頁（2005年）等に報告されており、こうした変異アセチルCoAカルボキシラーゼ遺伝子を遺伝子組換え技術により作物に導入するかもしくは抵抗性付与に関わる変異を作物アセチルCoAカルボキシラーゼに導入する事により、アセチルCoAカルボキシラーゼ阻害剤に耐性の作物を作出することができる。

【0019】

また、遺伝子組換え技術により耐性が付与された「作物」としては、例えばグリホサートやグルホシネート耐性のトウモロコシ品種があり、ラウンドアップレディ（Roundup Ready）<登録商標>及びリバティーリンク（Liberty Link）<登録商標>等の商品名で既に販売されている。

【0020】

上記「作物」には、遺伝子組換え技術を用いて、例えば、バチルス属で知られている選択的毒素等を合成する事が可能となった作物も含まれる。

この様な遺伝子組換え作物で発現される殺虫性毒素としては、例えばバチルス・セレウス（*Bacillus cereus*）やバチルス・ポピリアエ（*Bacillus popilliae*）由来の殺虫性タンパク；バチルス・チューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）由来のCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1またはCry9C等の - エンドトキシン、VIP1、VIP2、VIP3またはVIP3A等の殺虫性タンパク；線虫由来の殺虫性タンパク；さそり毒素、クモ毒素、ハチ毒素または昆虫特異的神経毒素等の動物によって産生される毒素；糸状菌類毒素；植物レクチン；アグルチニン；トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パバイン阻害剤等のプロテアーゼ阻害剤；リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、サボリン、プリオジン等のリボゾーム不活性化タンパク（RIP）；3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-UDP-グルコシルトランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ

10

20

30

40

50

等のステロイド代謝酵素；エクダイソン阻害剤；HMG-CoAリダクターゼ；ナトリウムチャンネル阻害剤、カルシウムチャンネル阻害剤等のイオンチャンネル阻害剤；幼若ホルモンエステラーゼ；利尿ホルモン受容体；スチルベンシンターゼ；ピベンジルシンターゼ；キチナーゼ；グルカナーゼ等が挙げられる。

またこの様な遺伝子組換え作物で発現される毒素として、Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1またはCry9C等の - エンドトキシタンパク、VIP1、VIP2、VIP3またはVIP3A等の殺虫性タンパクのハイブリッド毒素、一部を欠損した毒素、修飾された毒素も含まれる。ハイブリッド毒素は組換え技術を用いて、これらタンパクの異なるドメインの新しい組み合わせによって作り出される。一部を欠損した毒素としては、アミノ酸配列の一部を欠損したCry1Abが知られている。修飾された毒素としては、天然型毒素のアミノ酸の1つまたは複数置換されている。

これら毒素の例およびこれら毒素を合成することができる遺伝子組換え作物は、例えばEP-A-0374753、WO93/07278、WO95/34656、EP-A-0427529、EP-A-451878、WO03/052073等に記載されている。

これらの遺伝子組換え作物に含まれる毒素は、特に、甲虫目害虫、双翅目害虫、鱗翅目害虫への耐性を植物へ付与する。

#### 【0021】

また、1つもしくは複数の殺虫性の害虫抵抗性遺伝子を含み、1つまたは複数の毒素を発現する遺伝子組換え作物は既に知られており、いくつかのものは市販されている。これら遺伝子組換え作物の例として、イールドガード(Yield Guard)<登録商標>(Cry1Ab毒素を発現するトウモロコシ品種)、イールドガードルートワーム(Yield Guard Rootworm)<登録商標>(Cry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種)、イールドガードプラス(Yield Guard Plus)<登録商標>(Cry1AbとCry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種)、ハーキュレックスI(Herculex I)<登録商標>(Cry1Fa2毒素とグルホシネートへの耐性を付与する為のホスフィノトリシン N-アセチルトランスフェラーゼ(PAT)を発現するトウモロコシ品種)、NuCOTN33B<登録商標>(Cry1Ac毒素を発現するワタ品種)、ボルガードI(Bollgard I)<登録商標>(Cry1Ac毒素を発現するワタ品種)、ボルガードII(Bollgard II)<登録商標>(Cry1AcとCry2Ab毒素を発現するワタ品種)、VIPCOT<登録商標>(VIP毒素を発現するワタ品種)、ニューリーフ(New Leaf)<登録商標>(Cry3A毒素を発現するジャガイモ品種)、ネイチャーガード アグリシュアー GT アドバンテージ(Nature Gard<登録商標> Agrisure<登録商標> GT Advantage)(GA21グリホサート耐性形質)、アグリシュアー CB アドバンテージ(Agrisure<登録商標> CB Advantage)(Bt11コーンボラー(CB)形質)、プロテクタ(Protecta)<登録商標>等が挙げられる。

#### 【0022】

上記「作物」には、遺伝子組換え技術を用いて、選択的な作用を有する抗病原性物質を産生する能力を付与されたものも含まれる。

抗病原性物質としては、例えばPRタンパク(PRPs、EP-A-0392225に記載されている)；ナトリウムチャンネル阻害剤、カルシウムチャンネル阻害剤(ウイルスが産生するKP1、KP4、KP6毒素等が知られている)等のイオンチャンネル阻害剤；スチルベンシンターゼ；ピベンジルシンターゼ；キチナーゼ；グルカナーゼ；ペプチド抗生物質、ヘテロ環を有する抗生物質、植物病害抵抗性に関与するタンパク因子(植物病害抵抗性遺伝子と呼ばれ、WO03/000906に記載されている)等の微生物が産生する物質等が挙げられる。このような抗病原性物質とそれを産生する遺伝子組換え作物は、EP-A-0392225、WO95/33818、EP-A-0353191等に記載されている。

#### 【0023】

本発明除草用組成物は、通常、有効成分を適当な液体担体に溶解するか分散させるか、又は適当な固体担体と混合するか吸着させ、使用目的にとって都合の良い剤型に製剤化して使用する。本発明除草用組成物の製剤は、例えば乳剤、液剤、油剤、噴霧剤、水和剤、粉剤、DL（ドリフトレス）型粉剤、粒剤、微粒剤、微粒剤F、細粒剤F、顆粒水和剤、水溶剤、フロアブル剤、ドライフロアブル剤、ジャンボ剤、錠剤、ペースト剤等の形態である。これらの製剤は、必要に応じて、例えば乳化剤、分散剤、展着剤、浸透剤、湿潤剤、結合剤、増粘剤、防腐剤、酸化防止剤、着色剤等の製剤補助剤を更に添加され、公知の方法で調製することができる。

#### 【0024】

製剤化する際に使用される液体担体としては、例えば、水、アルコール類（例えば、メタノール、エタノール、1-プロパノール、2-プロパノール、エチレングリコール等）、ケトン類（例えば、アセトン、メチルエチルケトン等）、エーテル類（例えば、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、プロピレングリコールモノメチルエーテル等）、脂肪族炭化水素類（例えば、ヘキサン、オクタン、シクロヘキサン、灯油、燃料油、機械油等）、芳香族炭化水素類（例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、メチルナフタレン等）、ハロゲン化炭化水素類（例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等）、酸アミド類（例えば、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等）、エステル類（例えば、酢酸エチル、酢酸ブチル、脂肪酸グリセリンエステル等）、ニトリル類（例えば、アセトニトリル、プロピオニトリル等）等が挙げられる。これらの液体担体は2種以上を適当な割合で混合して使用することもできる。

10

20

#### 【0025】

製剤化する際に使用される固体担体としては、植物性粉末（例えば、大豆粉、タバコ粉、小麦粉、木粉等）、鉱物性粉末（例えば、カオリン、ベントナイト、酸性白土、クレイ等のクレイ類、滑石粉、ロウ石粉等のタルク類、珪藻土、雲母粉等のシリカ類等）、アルミナ、硫黄粉末、活性炭、糖類（例えば、乳糖、ブドウ糖等）、無機塩類（例えば、炭酸カルシウム、重炭酸ナトリウム等）、ガラス中空体（天然のガラス質を焼成加工してその中に気泡を内包させたもの）等が挙げられる。これらの固体担体は2種以上を適当な割合で混合して使用することもできる。

液体担体又は固体担体は、製剤全体に対して通常1～99重量%、好ましくは約10～99重量%の割合で用いられる。

30

#### 【0026】

製剤化する際に使用される乳化剤、分散剤、展着剤、浸透剤、湿潤剤等としては通常界面活性剤が用いられる。界面活性剤としては、例えば、アルキル硫酸エステル塩、アルキルアリアルスルホン酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテルリン酸エステル塩、リグニンスルホン酸塩、ナフタレンスルホネートホルムアルデヒド重縮合物等の陰イオン界面活性剤及びポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルポリオキシプロピレンブロックコポリマ-、ソルビタン脂肪酸エステル等の非イオン界面活性剤が挙げられる。これらの界面活性剤は2種以上を用いることもできる。界面活性剤は、製剤全体に対して通常0.1～50重量%、好ましくは約0.1～25重量%の割合で用いられる。

40

#### 【0027】

結合剤及び増粘剤としては、例えば、デキストリン、カルボキシメチルセルロースのナトリウム塩、ポリカルボン酸系高分子化合物、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、リグニンスルホン酸ナトリウム、リグニンスルホン酸カルシウム、ポリアクリル酸ナトリウム、アラビアガム、アルギン酸ナトリウム、マンニトール、ソルビトール、ベントナイト系鉱物質、ポリアクリル酸とその誘導体、カルボキシメチルセルロースのナトリウム塩、ホワイトカーボン、天然の糖類誘導体（例えば、キサンタンガム、グアーガム等）等が挙げられる。

50

## 【0028】

製剤中に含有される本発明除草用組成物の有効成分の合計量は、乳剤、水和剤、顆粒水和剤、液剤、水溶剤、フロアブル剤等では、製剤全体に対して通常1～90重量%の割合であり、油剤、粉剤、DL型粉剤等では、製剤全体に対して通常0.01～10重量%の割合であり、微粒剤、微粒剤F、細粒剤F、粒剤等では、製剤全体に対して通常0.05～10重量%の割合であるが、使用目的によってはこれらの濃度を適宜変更してもよい。乳剤、水和剤、顆粒水和剤、液剤、水溶剤、フロアブル剤等は、通常は水等で適宜希釈して使用されるが、通常は約100～100,000倍に希釈して使用する。

## 【0029】

本発明除草用組成物において、有効成分として用いられる一般式(I)で表される化合物と化合物Bの混合割合は、重量比で通常1:0.01～1:100、好ましくは重量比で1:0.1～1:10の範囲である。

10

## 【0030】

本発明除草用組成物は、夫々の有効成分を上述の製剤手法により製剤化した後、これらを混合することにより調製することもできる。

## 【0031】

本発明除草用組成物の施用方法は、通常の公知の農薬の施用方法と同様の方法を用いることができ、例えば、空中散布、土壌散布、茎葉散布等があげられる。

本発明除草用組成物を畑地又は水田用の除草剤として用いる場合の使用量は、適用地域、適用時期、施用方法、対象草種、栽培作物等により差異はあるが、通常は本発明除草用組成物の有効成分の合計量として畑地又は水田1ヘクタールあたり1～5000g程度、好ましくは10～1000g程度である。

20

本発明除草用組成物は畑地雑草防除用としては通常、出芽前土壌混和处理剤、出芽前土壌処理剤又は出芽後茎葉処理剤として使用される。水田雑草防除用としては通常、湛水土壌処理又は茎葉兼土壌処理剤として使用される。

## 【0032】

本発明除草用組成物は、さらに、1種又は2種以上の他の除草剤と混合又は併用して用いることにより雑草に対する除草効果増強を期待でき、さらに1種又は2種以上の殺虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、薬害軽減剤、肥料、土壌改良剤等と混合又は併用することもできる。

30

本発明除草用組成物と混用又は併用する除草剤との混合割合は、有効成分の重量比で通常1:0.01～1:100、好ましくは1:0.1～1:10の範囲である。

本発明除草用組成物と混用又は併用する殺虫剤との混合割合は、有効成分の重量比で通常1:0.01～1:100、好ましくは1:0.1～1:10の範囲である。

本発明除草用組成物と混用又は併用する殺菌剤との混合割合は、有効成分の重量比で通常1:0.01～1:100、好ましくは1:0.1～1:10の範囲である。

本発明除草用組成物と混用又は併用する植物生長調節剤との混合割合は、有効成分の重量比で通常1:0.00001～1:100、好ましくは1:0.0001～1:1の範囲である。

本発明除草用組成物と混用又は併用する薬害軽減剤との混合割合は、有効成分の重量比で通常1:0.001～1:100、好ましくは1:0.01～1:10の範囲である。

40

本発明除草用組成物と混用又は併用する肥料との混合割合は、有効成分の重量比で通常1:0.1～1:1000、好ましくは1:1～1:200の範囲である。

## 【0033】

本発明除草用組成物として使用することのできる、他の除草剤の有効成分としては、例えば、

(1) フェノキシ脂肪酸系除草性化合物 [ MCP、MCPB、フェノチオール (phenothio1)、メコプロップ (mecoprop)、フルロキシビル (fluroxypyr)、トリクロピル (triclopyr)、クロメプロップ (clomeprop)、ナプロアニリド (naproanilide) 等 ]、

50



(2) 安息香酸系除草性化合物 [ 2, 3, 6 - TBA、クロピラリド ( clopyralid )、ピクロラム ( picloram )、アミノピラリド ( aminopyralid )、キンクロラック ( quinclorac )、キンメラック ( quinmerac ) 等 ]、

(3) 尿素系除草性化合物 [ ジウロン ( diuron )、リニユロン ( linuron )、クロルトロン ( chlortoluron )、イソプロツロン ( isoproturon )、フルオメツロン ( fluometuron )、イソウロン ( isouron )、テブチウロン ( tebuthiuron )、メタベンズチアズロン ( methabenzthiazuron )、クミルロン ( cumyluron )、ダймロン ( daimuron )、メチルダймロン ( methyl - daimuron ) 等 ]、

(4) トリアジン系除草性化合物 [、アメトリン ( ametryn )、シアナジン ( cyanazine )、シマジン ( simazine )、プロバジン ( propazine )、シメトリン ( simetryn )、ジメタメトリン ( dimethametryn )、プロメトリン ( prometryn )、メトリブジン ( metribuzin )、トリアジフラム ( triaziflam ) 等 ]、

(5) ビピリジニウム系除草性化合物 [ パラコート ( paraquat )、ジクワット ( diquat ) 等 ]、

(6) ヒドロキシベンゾニトリル系除草性化合物 [ ブロモキシニル ( bromoxynil )、アイオキシニル ( ioxynil ) 等 ]、

(7) ジニトロアニリン系除草性化合物 [ ペンディメタリン ( pendimethalin )、プロジアミン ( prodiamine )、トリフルラリン ( trifluralin ) 等 ]、

(8) 有機リン系除草性化合物 [ アミプロホスメチル ( amiprofos - methyl )、ブタミホス ( butamifos )、ベンスリド ( bensulide )、ピペロホス ( piperophos )、アニロホス ( anilofos )、グルホシネート ( glufosinate )、ビアラホス ( bialaphos ) 等 ]、

(9) カーバメート系除草性化合物 [ ジアレート ( di - allate )、トリアレート ( tri - allate )、EPTC、ブチレート ( butylate )、ベンチオカーブ ( benthocarb )、エスプロカルブ ( esprocarb )、モリネート ( molinate )、ジメピペレート ( dimepiperate )、スエップ ( sweep )、クロルプロファミ ( chlorpropham )、フェンメディファミ ( phenmedipham )、フェニソファミ ( phenisopham )、ピリブチカルブ ( pyributicarb )、アシュラム ( asulam ) 等 ]、

(10) 酸アミド系除草性化合物 [ プロパニル ( propanil )、プロピザミド ( propyzamide )、プロモブチド ( bromobutide )、エトベンザニド ( etobenzanid ) 等 ]、

(11) クロロアセトアニリド系除草性化合物 [ アラクロール (alachlor)、ブタクロール ( butachlor )、ジメテナミド ( dimethenamid )、プロパクロール ( propachlor )、メタザクロール ( metazachlor )、プレチラクロール ( pretilachlor )、テニルクロール ( thenylchlor )、ペトキサミド ( pethoxamid ) 等 ]、

(12) ジフェニルエーテル系除草性化合物 [ アシフルオルフェン ( acifluorfen - sodium )、ビフェノックス ( bifenox )、オキシフルオルフェン ( oxyfluorfen )、ラクトフェン ( lactofen )、フォメサフェン ( fomesafen )、クロメトキシニル ( chlomethoxynil )、アクロニフェン ( aclonifen ) 等 ]、

(13) 環状イミド系除草性化合物 [ オキサジアゾン ( oxadiazon )、シニドンエチル ( cinidon - ethyl )、カルフェントラゾンエチル ( carfentrazone - ethyl )、スルフェントラゾン ( surfentrazone )、フルミクロラックペンチル ( flumiclorac - pentyl )、ピラフルフェンエチ

10

20

30

40

50

ル (pyraflufen-ethyl)、オキサジアルギル (oxadiargyl)、  
 ペントキサゾン (pentoxazone)、フルチアセットメチル (fluthiacet-methyl)、  
 ブタフェナシル (butafenacil)、ベンズフェンジ  
 ゾン (benzfenidzone) 等]、

(14) ピラゾール系除草性化合物 [ベンゾフェナップ (benzofenap)、ピラ  
 ゾレート (pyrazolate)、ピラゾキシフェン (pyrazoxyfen)、ト  
 プラメゾン (topramezone)、ピラスルホトール (pyrasulfotole)  
 e) 等]、

(15) トリケトン系除草性化合物 [イソキサフルトール (isoxaflutole)  
 、ベンゾビスクロン (benzobicyclon)、スルコトリオン (sulcotri  
 one)、メソトリオン (mesotrione)、テンボトリオン (tembotri  
 one)、テフリルトリオン (tefuryltrione) 等]、

(16) アリアルオキシフェノキシプロピオン酸系除草性化合物 [シハロホップブチル (c  
 yhalofop-butyl)、ジクロホップメチル (diclofop-methyl)、フェノキサプロップエチル (fenoxaprop-ethyl)、フルアジホ  
 ップブチル (fluaazifop-butyl)、ハロキシホップメチル (haloxy  
 fop-methyl)、キザロホップエチル (quizalofop-ethyl)、  
 メタミホップ (metamifop) 等]、

(17) トリオンオキシム系除草性化合物 [アロキシジム (alloxydim-sod  
 ium)、セトキシジム (sethoxydim)、ブトロキシジム (butoxydi  
 m)、クレソジム (clethodim)、クロプロキシジム (cloproxydi  
 m)、シクロキシジム (cycloxydim)、テブラロキシジム (tepralox  
 ydim)、トラルコキシジム (tralkoxydim)、プロフォキシジム (pro  
 foxydim) 等]、

(18) スルホニル尿素系除草性化合物 [クロルスルフロン (chlorsulfuro  
 n)、スルホメツロンメチル (sulfometuron-methyl)、メトスルフ  
 ロンメチル (metsulfuron-methyl)、トリベニユロンメチル (tri  
 benuron-methyl)、トリアスルフロン (triasulfuron)、ベン  
 スルフロンメチル (bensulfuron-methyl)、チフェンスルフロンメ  
 チル (thifensulfuron-methyl)、ピラゾスルフロンエチル (py  
 razosulfuron-ethyl)、プリミスルフロンメチル (primisul  
 furon-methyl)、ニコスルフロン (nicosulfuron)、アミドス  
 ルフロン (amidosulfuron)、シノスルフロン (cinosulfuron)  
 )、イマゾスルフロン (imazosulfuron)、リムスルフロン (rimsul  
 furon)、ハロスルフロンメチル (halosulfuron-methyl)、プ  
 ロスルフロン (prosulfuron)、エタメトスルフロンメチル (ethamet  
 sulfuron-methyl)、トリフルスルフロンメチル (triflusul  
 furon-methyl)、フラザスルフロン (flazasulfuron)、シクロ  
 スルファミロン (cyclosulfamuron)、フルピルスルフロン (flupy  
 rsulfuron)、スルホスルフロン (sulfosulfuron)、アジムスル  
 フロン (azimsulfuron)、エトキシスルフロン (ethoxysulfur  
 on)、オキサスルフロン (oxasulfuron)、ヨードスルフロンメチルナトリ  
 ウム (iodosulfuron-methyl-sodium)、フォラムスルフロ  
 ン (foramsulfuron)、メソスルフロンメチル (mesosulfuron-  
 methyl)、トリフロキシスルフロン (trifloxysulfuron)、トリ  
 トスルフロン (tritofluron)、オルソスルファミロン (orthosu  
 lfamuron)、フルセトスルフロン (flucetosulfuron) 等]、

(19) イミダゾリノン系除草性化合物 [イマザメタバズメチル (imazameth  
 abenz-methyl)、イマザメタピル (imazamethapyr)、イマザ  
 モックス (imazamox)、イマザピル (imazapyr)、イマザキン (ima

10

20

30

40

50

zaquin)、イマゼタピル(imazethapyr)等]、  
 (20)スルホンアミド系除草性化合物[フルメトスラム(flumetsulam)、  
 メトスラム(metosulam)、ジクロスラム(diclosulam)、フロラス  
 ラム(florasulam)、ペノキススラム(penoxsulam)、ピロキスス  
 ラム(pyroxulam)等]、

(21)ピリミジニルオキシ安息香酸系除草性化合物[ピリチオバックナトリウム(py  
 rithiobac-sodium)、ビスピリバックナトリウム(bispyribac  
 -sodium)、ピリミノバックメチル(pyriminobac-methyl)  
 、ピリベンゾキシム(pyribenzoxim)、ピリフタリド(pyrifthalid  
 )、ピリミスルファン(pyrimisulfan)等]、

10

(22)その他の系統の除草性化合物[ベンタゾン(bentazon)、プロマシル(b  
 romacil)、ターバシル(terbacil)、クロルチアミド(chlort  
 hiamid)、イソキサベン(isoxaben)、ジノセブ(dinoseb)、ア  
 ミトロール(amitrole)、シンメチリン(cinmethylin)、トリジフ  
 アン(tridiphane)、ダラボン(dalapon)、ジフルフェンゾピルナト  
 リウム(diflufenzopyr-sodium)、ジチオピル(dithiopy  
 r)、チアゾピル(thiazopyr)、フルカルバゾンナトリウム(flucarb  
 azone-sodium)、プロポキシカルバゾンナトリウム(propoxycar  
 bazine-sodium)、メフェナセツト(mefenacet)、フルフェナセ  
 ット(flufenacet)、フェントラザミド(fentrazamide)、カフ  
 エンストロール(cafenstrole)、インダノファン(indanofan)、  
 オキサジクロメホン(oxaziclomefone)、ベンフレセート(benfur  
 esate)、ACN、ピリデート(pyridate)、クロリダゾン(chlori  
 dazon)、ノルフルラゾン(norflurazon)、フルルタモン(flurt  
 amone)、ジフルフェニカン(diflufenican)、ピコリナフェン(pi  
 colinafen)、ベフルブタミド(beflubutamid)、クロマゾン(c  
 lomazone)、アミカルバゾン(amicarbazine)、ピラクロニル(p  
 yraclonil)、ピロキサスルホン(pyroxasulfone)、チエンカル  
 バゾンメチル(thiencarbazine-methyl)等]等が挙げられ、

20

植物生長調節剤の有効成分としては、例えば、ヒメキサゾール(hymexazol)  
 、パクロブトラゾール(paclobutrazol)、ウニコナゾール-P(unic  
 onazole-P)、イナベンフィド(inabenfide)、プロヘキサジオンカ  
 ルシウム(prohexadione-calcium)等が挙げられ、

30

殺菌剤の有効成分としては、例えば、

(1)ポリハロアルキルチオ系殺菌性化合物[キャプタン(captan)等]、  
 (2)有機リン系殺菌性化合物[IBP、EDDP、トルクロフォスメチル(tolcl  
 ofos-methyl)等]、  
 (3)ベンズイミダゾール系殺菌性化合物[ベノミル(benomyl)、カルベンダジ  
 ム(carbendazim)、チオファネートメチル(thiophanate-me  
 thyl)等]、

40

(4)カルボキシアミド系殺菌性化合物[カルボキシ(carboxin)、メプロニ  
 ル(mepronil)、フルトラニル(flutolanil)、チフルザミド(th  
 ifluzamid)、フラメトピル(furametpyr)、ボスカリド(bosc  
 alid)、ペンチオピラド(penthiopyrad)等]、  
 (5)ジカルボキシイミド系殺菌性化合物[プロシミドン(procymidone)、  
 イプロジオン(iprodione)、ビンクロゾリン(vinclozolin)等]

(6)アシルアラニン系殺菌性化合物[メタラキシル(metalaxy)等]、

(7)アゾール系殺菌性化合物[トリアジメフォン(triadimefon)、トリア  
 ジメノール(triadimenol)、プロピコナゾール(propiconazol

50

e)、テブコナゾール (tebuconazole)、シプロコナゾール (cypconazole)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、プロチオコナゾール (prothioconazole)、イブコナゾール (ipconazole)、トリフルミゾール (triflumizole)、プロクロラズ (prochloraz) 等]、

(8) モルフォリン系殺菌性化合物 [ドデモルフ (dodemorph)、トリデモルフ (tridemorph)、フェンプロピモルフ (fenpropimorph) 等]、

(9) ストロビルリン系殺菌性化合物 [アゾキシストロビン (azoxystrobin)、クレソキシムメチル (kresoxim-methyl)、メトミノストロビン (metominostrobin)、トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)、ピコキシストロビン (picoxystrobin)、ピラクロストロビン (pyraclostrobin) 等]、

(10) 抗生物質系殺菌性化合物 [バリダマイシン A (validamycin A)、ブラストサイジン S (blasticidin S)、カスガマイシン (kasugamycin)、ポリオキシン (polyoxin) 等]、

(11) ジチオカーバメート系殺菌性化合物 [マンコゼブ (mancozeb)、マネブ (maneb) 等]、

(12) その他の殺菌性化合物 [フサライド (fthalide)、プロベナゾール (probenazole)、イソプロチオラン (isoprothiolane)、トリシクラゾール (tricyclazole)、ピロキノロン (pyroquinolon)、フェリムゾン (ferimzone)、アシベンゾラル S メチル (acibenzolar S-methyl)、カルプロパミド (carpropamid)、ジクロシメット (diclocymet)、フェノキサニル (fenoxanil)、チアジニル (tiadinil)、ジクロメジン (diclomezine)、テクロフタラム (teclofthalam)、ペンシクロン (pencycuron)、オキシリニック酸 (oxolinic acid)、TPN、トリフォリン (triforine)、フェンプロピジン (fenpropidin)、スピロキサミン (spiroxamine)、フルアジナム (fluazinam)、イミノオクタジン (iminooctadine)、フェンピクロニル (fenpiclonil)、フルジオキシニル (fludioxonil)、キノキシフェン (quinoxifen)、フェンヘキサミド (fenhexamid)、シルチオフアム (siltiofam)、プロキナジド (proquinazid)、シフルフェナミド (cyflufenamid)、塩基性硫酸銅カルシウム (bordeaux mixture) 等] 等が挙げられ、

殺虫剤の有効成分としては、例えば、

(1) 有機リン系殺虫性化合物 [フェンチオン (fenthion)、フェニトロチオン (fenitrothion)、ピリミホスメチル (pirimiphos-methyl)、ダイアジノン (diazinon)、キナルホス (quinalphos)、イソキサチオン (isoxathion)、ピリダフェンチオン (pyridafenthion)、クロルピリホスメチル (chlorpyrifos-methyl)、バミドチオン (vamidothion)、マラチオン (malathion)、フェントエート (phenthoate)、ジメトエート (dimethoate)、ジスルホトン (disulfoton)、モノクロトホス (monocrotophos)、テトラクロルビンホス (tetrachlorvinphos)、クロルフェンビンホス (chlorfenvinphos)、プロパホス (propaphos)、アセフェート (acephate)、トリクロルホン (trichlorphon)、EPN、ピラクロホス (pyraclofos) 等]、

(2) カルバメート系殺虫性化合物 [カルバリル (carbaryl)、メトルカルブ (metolcarb)、イソプロカルブ (isoprocarb)、BPMC、プロポキスル (propoxur)、XMC、カルボフラン (carbofuran)、カルボスルファン (carbosulfan)、ベンフラカルブ (benfuracarb)、フ

10

20

30

40

50

ラチオカルブ (furathiocarb)、メソミル (methomyl)、チオジカルブ (thiodicarb) 等]、

(3) 合成ピレスロイド系殺虫性化合物 [テフルトリン (tefluthrin)、ピフエントリン (bifenthrin)、シクロプロトリン (cycloprothrin)、エトフェンプロックス (ethofenprox) 等]、

(4) ネライストキシン系殺虫性化合物 [カルタップ (cartap)、ベンスルタップ (bensultap)、チオシクラム (thiocyclam) 等]、

(5) ネオニコチノイド系殺虫性化合物 [イミダクロプリド (imidacloprid)、ニテンピラム (nitenpyram)、アセタミプリド (acetamiprid)、チアメトキサム (thiamethoxam)、チアクロプリド (thiacloprid)、ジノテフラン (dinotefuran)、クロチアニジン (clothianidin) 等]、

(6) ベンゾイルフェニル尿素系殺虫性化合物 [クロルフルアズロン (chlorfluzuron)、フルフェノクスロン (flufenoxuron)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ルフエヌロン (lufenuron)、ノバルロン (novaluron) 等]、

(7) マクロライド系殺虫性化合物 [エマメクチン (emamectin)、スピノサド (spinosad) 等]、

(8) その他の殺虫性化合物 [ブプロフェジン (buprofezin)、テブフェノジド (tebufenozide)、フィプロニル (fipronil)、エチプロール (ethiprole)、ピメトロジン (pymetrozine)、ジアフェンチウロン (diafenthiuron)、インドキサカルブ (indoxacarb)、トルフェンピラド (tolfenpyrad)、ピリダリル (pyridalyl)、フロニカミド (flonicamid)、フルベンジアミド (flubendiamide)、リナキシピル (Rynaxypyr)、シアジピル (Cyazypyr) 等] 等が挙げられ

、  
殺ダニ剤の有効成分としては、例えば、ヘキシチアゾクス (hexythiazox)、ピリダベン (pyridaben)、フェンピロキシメート (fenpyroximate)、テブフェンピラド (tebufenpyrad)、クロルフェナピル (chlorfenapyr)、エトキサゾール (etoxazole)、プリミジフェン (pyrimidifen)、アセキノシル (acequinocyl)、ピフェナゼート (bifenazate)、スピロジクロフェン (spirodiclofen) 等が挙げられ

、  
殺線虫剤の有効成分としては、例えば、フォスチアゼート (fosthiazate)、カズサフォス (cadusafos) 等が挙げられる。

肥料としては、例えば尿素等の窒素肥料等が挙げられる。

#### 【0034】

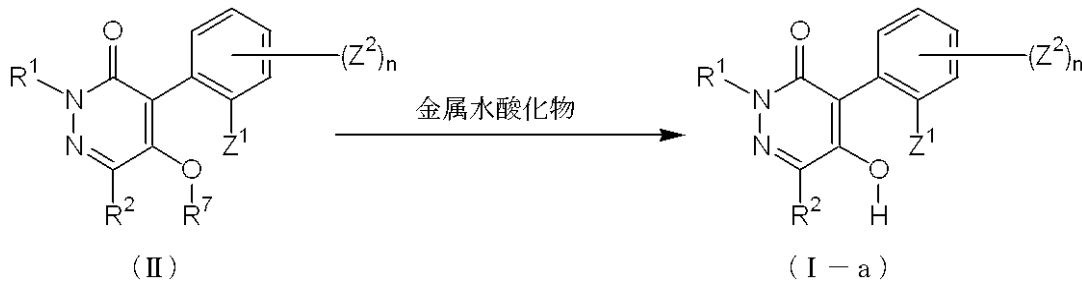
本発明除草用組成物には、更に薬害軽減剤 (例えば、フリラゾール (furilazole)、ジクロルミッド (dichlormid)、ベノキサコール (benoxacor)、アリドクロール (allidochlor)、イソキサジフェンエチル (isoxadifen-ethyl)、フェンクロリム (fenclorim)、シプロスルファミド (cyprosulfamide)、シオメトリニル (cyometrinil)、オキサベトリニル (oxabetrinil)、フルクソフェニム (fluxofenim)、フルラゾール (flurazole)、1,8-ナフタル酸無水物 (1,8-naphthalic anhydride) 等)、色素等を適宜混合してもよい。

#### 【0035】

本化合物は、例えば以下の製造法により製造することができる。

##### 製造法 1

本化合物のうち G が水素原子である、一般式 (I-a) で示される化合物は、一般式 (II) で示される化合物に金属水酸化物を反応させることによって、製造することができる



〔式中、 $R^7$ は $C_{1-6}$ アルキル基（例えば、メチル基、エチル基等）を表し、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $Z^1$ 、 $Z^2$ 及び $n$ は前記と同じ意味を表す。〕 10

本反応は通常溶媒中で行う。使用できる溶媒としては、例えば、水；テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル系溶媒、又はこれらの混合溶媒が挙げられる。

本反応に用いられる金属水酸化物としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属の水酸化物等が挙げられる。本反応に用いられる金属水酸化物の使用量は、一般式(II)で示される化合物に対して、通常1～120モル当量、好ましくは1～40モル当量である。

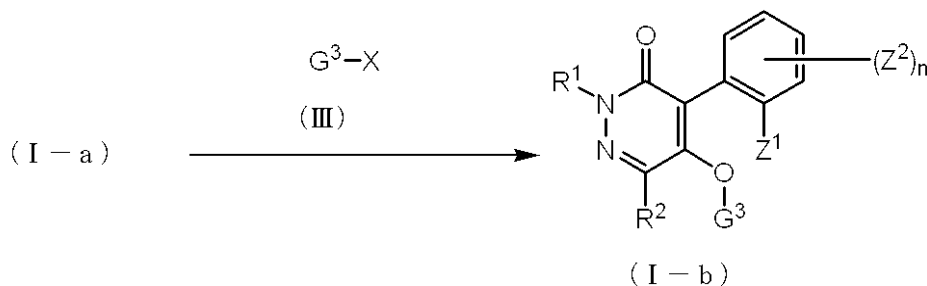
本反応の反応温度は、通常室温から使用する溶媒の沸点の範囲であり、好ましくは溶媒の沸点である。なお本反応は封管又は耐圧密閉容器中で加熱して行うこともできる。本反応の反応時間は、通常5分～数週間程度である。 20

本反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。本反応の終了後、例えば反応混合物に酸を添加して中和し、水と混合し、有機溶媒にて抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の操作を行うことにより、一般式(I-a)で示される化合物を単離することができる。

#### 【0036】

##### 製造法2

本化合物のうちGが水素原子以外の基である、一般式(I-b)で示される化合物は、一般式(I-a)で示される化合物と一般式(III)で示される化合物から製造することができる。 30



〔式中、 $G^3$ はGの定義のうち水素原子以外の基を表し、Xはハロゲン原子（例えば、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等）又は式 $OG^3$ で表される基を表し、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $Z^1$ 、 $Z^2$ 及び $n$ は前記と同じ意味を表す。〕 40

本反応は溶媒中で行うことができる。使用できる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類；ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類；ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類；スルホラン等のスルホン類、又はこれらの混合溶媒が挙げられる。

本反応に用いられる一般式(III)で示される化合物としては、例えば、塩化アセチル、塩化プロピオニル、塩化イソブチリル、塩化ピバロイル、塩化ベンゾイル、シクロヘキサノールカルボン酸クロリド等のカルボン酸のハロゲン化物；無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸 50

酸等のカルボン酸の無水物；クロロギ酸メチル、クロロギ酸エチル、クロロギ酸フェニル等の炭酸半エステルのハロゲン化物；塩化ジメチルカルバモイル等のカルバミン酸のハロゲン化物；塩化メタンスルホニル、塩化p-トルエンスルホニル等のスルホン酸のハロゲン化物；メタンスルホン酸無水物、トリフルオロメタンスルホン酸無水物等のスルホン酸の無水物；ジメチルクロロホスファート等のリン酸エステルのハロゲン化物等が挙げられる。本反応に用いられる一般式(III)で示される化合物の使用量は、一般式(I-a)で示される化合物に対して、通常1モル当量以上、好ましくは1~3モル当量である。

本反応は通常、塩基の存在下で行う。本反応において用いられる塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン等の有機塩基；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が挙げられる。本反応に用いられる塩基の使用量は、一般式(I-a)で示される化合物に対して、通常0.5~10モル当量、好ましくは1~5モル当量である。

本反応の反応温度は通常、-30~180、好ましくは-10~50である。本反応の反応時間は通常、10分~30時間である。

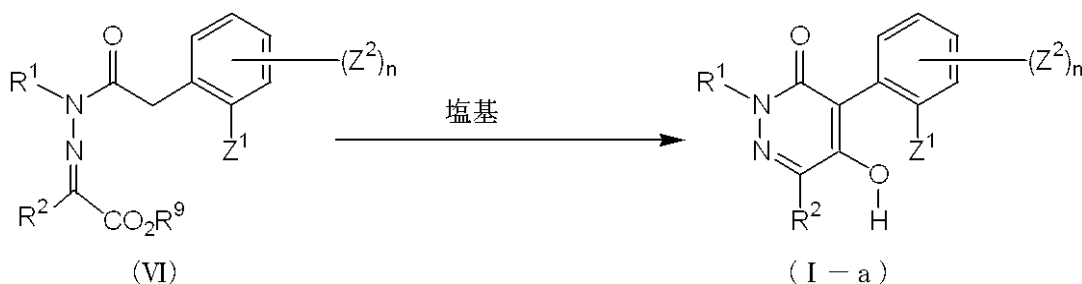
本反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。本反応の終了後、例えば反応混合物と水とを混合し、有機溶媒にて抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の操作を行うことにより、一般式(I-b)で示される化合物を単離することができる。

一般式(III)で示される化合物は公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から製造することができる。

【0037】

### 製造法3

本化合物のうちGが水素原子である、一般式(I-a)で示される化合物は、また以下の製造法により製造することもできる。即ち、一般式(VI)で示される化合物に塩基を作用させることによって、一般式(I-a)で示される化合物を製造することができる。



〔式中、R<sup>9</sup>はC<sub>1-6</sub>アルキル基（例えば、メチル基、エチル基等）を表し、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、Z<sup>1</sup>、Z<sup>2</sup>及びnは前記と同じ意味を表す。〕

本反応は通常溶媒中で行う。使用できる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類；ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類；スルホラン等のスルホン類、又はこれらの混合溶媒が挙げられる。

本反応に用いられる塩基としては、例えば、カリウムtert-ブトキシド等の金属アルコキシド、水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。本反応に用いられる塩基の使用量は、一般式(VI)で示される化合物に対して、通常1~10モル当量、好ましくは2~5モル当量である。

本反応の反応温度は通常-60~180、好ましくは-10~100である。本反

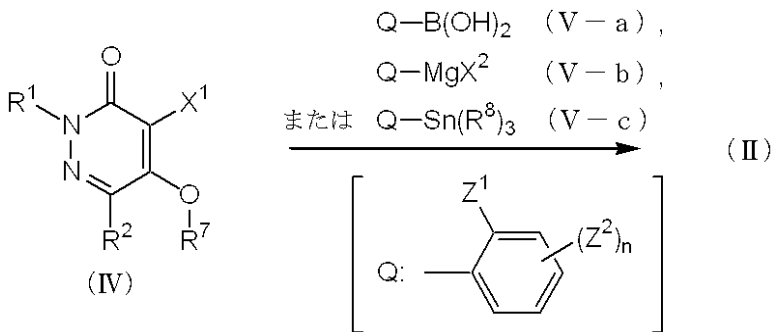
応の反応時間は通常10分～30時間である。

本反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。本反応の終了後、例えば反応混合物に酸を添加して中和し、水と混合し、有機溶媒にて抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の操作を行うことにより、一般式(I-a)で示される化合物を単離することができる。

【0038】

参考製造法1

一般式(II)で示される化合物は、例えば、以下の製造法により製造することができる。



〔式中、 $X^1$ は脱離基(例えば、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等のハロゲン原子等)を表し、 $X^2$ はハロゲン原子(例えば、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等)を表し、 $R^8$ は $C_{1-6}$ アルキル基(例えば、メチル基、ブチル基等)を表し、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^7$ 、 $Z^1$ 、 $Z^2$ 及び $n$ は前記と同じ意味を表す。〕

本反応においては、一般式(IV)で示される化合物を、一般式(V-a)、(V-b)又は(V-c)で示される有機金属試薬(通常、一般式(IV)で示される化合物に対して1モル当量以上、好ましくは1～3モル当量)とカップリング反応させることにより、一般式(II)で示される化合物を製造することができる。

一般式(V-a)で示される化合物を用いる反応は、溶媒中で行う。使用できる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類；メタノール、エタノール、プロパノール等のアルコール類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサソ、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類；ジメチルスルホキシド等のスルホキシド類；スルホラン等のスルホン類；水、又はこれらの混合溶媒が用いられる。

また、一般式(V-a)で示される化合物を用いる反応は、塩基の存在下に行う。使用できる塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、ジメチルアミノピリジン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン等の有機塩基；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム、炭酸セシウム、リン酸カリウム等の無機塩基が挙げられる。用いられる塩基の使用量は、一般式(IV)で示される化合物に対して、通常0.5～10モル当量、好ましくは1～5モル当量である。

更に、一般式(V-a)で示される化合物を用いる反応は、触媒の存在下に行う。使用できる触媒としては、例えば、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム等のパラジウム触媒等が挙げられる。用いられる触媒の使用量は、一般式(IV)で示される化合物に対して、通常0.001～0.5モル当量、好ましくは0.01～0.2モル当量である。また一般式(V-a)で示される化合物を用いる反応は、4級アンモニウム塩を添加することが好ましい。使用することのできる4級アンモニウム塩としては、例えば、臭化テトラブチルアンモニウム等が挙げられる。

一般式(V-a)で示される化合物を用いる反応の反応温度は、通常20～180、

10

20

30

40

50



好ましくは60～150である。該反応の反応時間は通常30分～100時間である。該反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。該反応の終了後、例えば反応混合物と水とを混合し、有機溶媒にて抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の操作を行うことにより、一般式(II)で示される化合物を単離することができる。

一般式(V-b)で示される化合物を用いる反応は、溶媒中で行う。使用できる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサソ、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類；又はこれらの混合溶媒が挙げられる。

一般式(V-b)で示される化合物を用いる反応は、触媒の存在下に行う。使用できる触媒としては、例えば、ジクロロビス(1,3-ジフェニルホスフィノ)プロパンニッケル、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)ニッケル等のニッケル触媒、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム等のパラジウム触媒等が挙げられる。用いられる触媒の使用量は、一般式(IV)で示される化合物に対して、通常0.001～0.5モル当量、好ましくは0.01～0.2モル当量である。

一般式(V-b)で示される化合物を用いる反応の反応温度は、通常-80～180、好ましくは-30～150である。該反応の反応時間は通常30分～100時間である。該反応の終了は反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。該反応の終了後、例えば反応混合物と水とを混合し、有機溶媒にて抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の操作を行うことにより、一般式(II)で示される化合物を単離することができる。

一般式(V-c)で示される化合物を用いる反応は、溶媒中で行う。使用できる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサソ、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類；クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類；又はこれらの混合溶媒が挙げられる。

一般式(V-c)で示される化合物を用いる反応は、触媒の存在下に行う。使用できる触媒としては、例えば、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム等のパラジウム触媒等が挙げられる。用いられる触媒の使用量は、一般式(IV)で示される化合物に対して、通常0.001～0.5モル当量、好ましくは0.01～0.2モル当量である。

一般式(V-c)で示される化合物を用いる反応の反応温度は、通常-80～180、好ましくは-30～150である。該反応の反応時間は通常30分～100時間である。該反応の終了は反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。該反応の終了後、例えば反応混合物と水とを混合し、有機溶媒にて抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の操作を行うことにより、一般式(II)で示される化合物を単離することができる。

一般式(II)で示される化合物は、例えばテトラヘドロン(Tetrahedron)、57巻、1323～1330頁(2001年)等に記載されている方法に準じる方法に従い製造することができる。

一般式(V-a)、(V-b)又は(V-c)で示される有機金属試薬は公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から公知の方法に準じる方法に従い製造することができる。

一般式(IV)で示される化合物は、公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から製造することができる。例えばジャーナル・オブ・ヘテロサイクリック・ケミストリー(J. Heterocycl. Chem.)、33巻、1579～1582頁(1996年)等に記載されている方法、又はそれらに準じる方法に従い製造することができる。

【0039】

参考製造法2

10

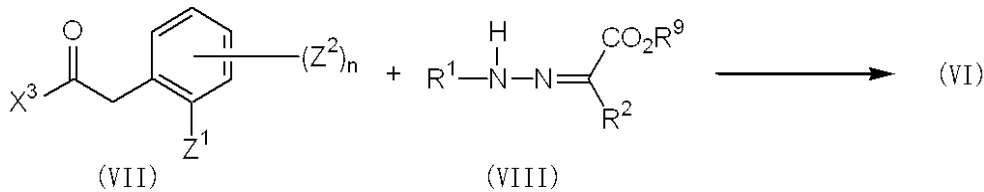
20

30

40

50

一般式 (VI) で示される化合物は例えば、以下の製造法により製造することができる。



[式中、 $X^3$ はハロゲン原子(例えば、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等)を表し、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^9$ 、 $Z^1$ 、 $Z^2$ 及び $n$ は前記と同じ意味を表す。]

本反応は通常溶媒中で行う。使用できる溶媒としては、例えば、アセトニトリル等のニトリル類、アセトン等のケトン類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類；ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類；スルホラン等のスルホン類、又はこれらの混合溶媒が挙げられる。

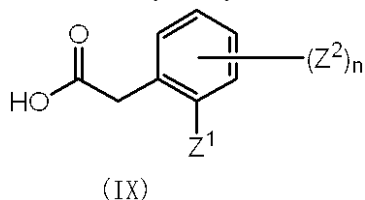
また、本反応は通常、塩基の存在下に一般式 (VII) で示される化合物と一般式 (VIII) で示される化合物とを反応させるが、本反応において用いられる塩基としては例えば、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、ピリジン、ジメチルアミノピリジン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン等の有機塩基；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が挙げられる。

本反応において、一般式 (VIII) で示される化合物は、一般式 (VII) で示される化合物に対して、通常1モル当量以上、好ましくは1~3モル当量である。塩基は、一般式 (VII) で示される化合物に対して、通常0.5~10モル当量、好ましくは1~5モル当量である。

本反応の反応温度は通常-30~180、好ましくは-10~50である。本反応の反応時間は通常10分~30時間である。

本反応の終了は、反応混合物の一部をサンプリングして、薄層クロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィー等の分析手段により確認することができる。本反応の終了後、例えば反応混合物と水とを混合し、有機溶媒にて抽出し、得られた有機層を乾燥、濃縮する等の操作を行うことにより、一般式 (VI) で示される化合物を単離することができる。

一般式 (VII) で示される化合物は、一般式 (IX)



[式中、 $Z^1$ 、 $Z^2$ 及び $n$ は前記と同じ意味を表す。]

で示される化合物をハロゲン化剤(例えば、塩化チオニル、臭化チオニル、オキシ塩化リン、塩化オキサリル等)と反応させることにより製造することができる。

一般式 (IX) で示される化合物は公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から製造することができる。例えば、オーガニック・シンセシズ・コレクティブ・ボリューム(Organic Syntheses Collective Volume)、3巻、557~560頁(1955年)、ジャーナル・オブ・アメリカン・ケミカル・ソサエティ(J. Am. Chem. Soc.)、63巻、2643~2644頁(1941年)、国際公開第2006/056282号パンフレット(WO2006/056282)等に記載されている方法、又はそれらに準じる方法に従い製造することができる。一般式 (IX) で示される化合物としては例えば、2,4,6-トリメチルフェニル酢酸、2,4,6

- トリエチルフェニル酢酸、2,6-ジエチル-4-メチルフェニル酢酸、2-エチルフェニル酢酸、2-エチル-4-メチルフェニル酢酸、2-エチル-4,6-ジメチルフェニル酢酸、2,4-ジエチルフェニル酢酸、2,6-ジエチルフェニル酢酸、2,4-ジエチル-6-メチルフェニル酢酸等があげられる。

一般式(VIII)で示される化合物は、公知の化合物であるか、あるいは公知の化合物から製造することができる。

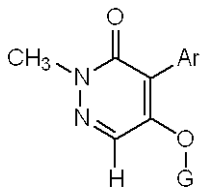
【0040】

上記の製造法1~3又は参考製造法1~2により製造される各化合物は、その他の公知の手段、例えば濃縮、減圧濃縮、抽出、転溶、結晶化、再結晶化、クロマトグラフィー等の方法によっても、単離・精製することができる場合がある。

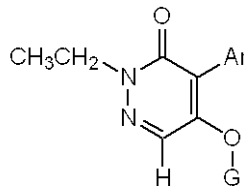
10

【0041】

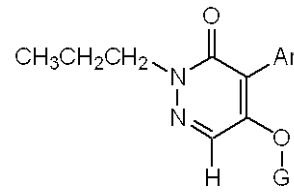
次に、本発明除草用組成物の有効成分として用いられる一般式(I)の化合物の具体例を以下に示す。



(I<sup>1</sup>)

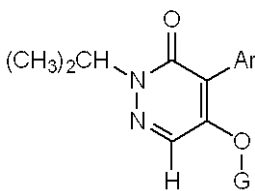


(I<sup>2</sup>)

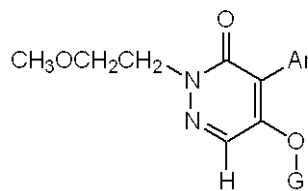


(I<sup>3</sup>)

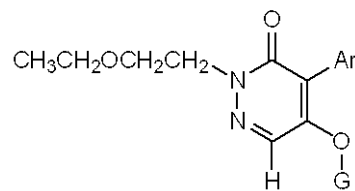
20



(I<sup>4</sup>)

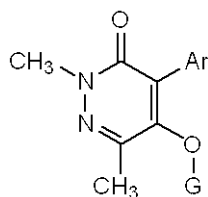


(I<sup>5</sup>)

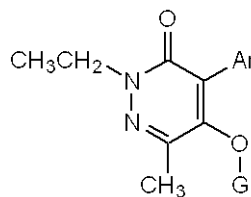


(I<sup>6</sup>)

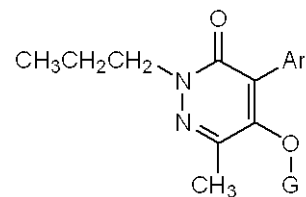
【0042】



(I<sup>7</sup>)

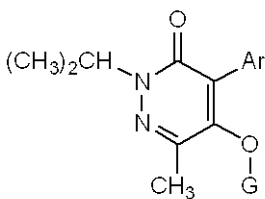


(I<sup>8</sup>)

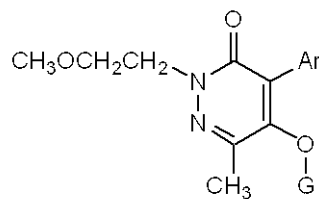


(I<sup>9</sup>)

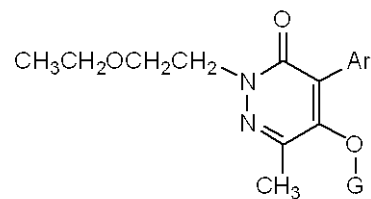
30



(I<sup>10</sup>)



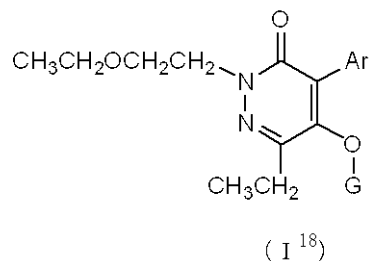
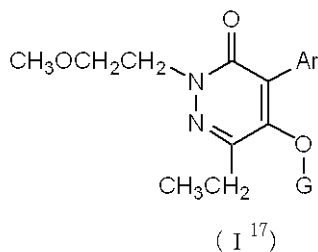
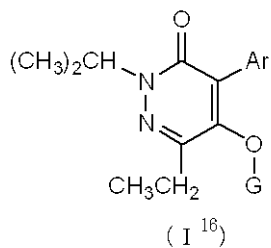
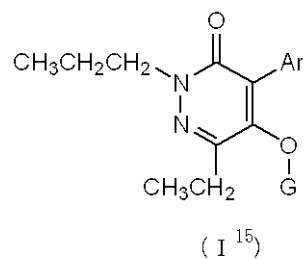
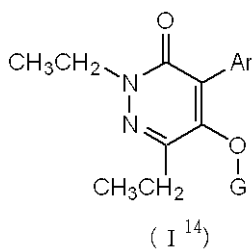
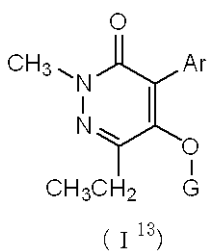
(I<sup>11</sup>)



(I<sup>12</sup>)

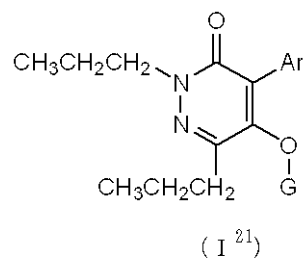
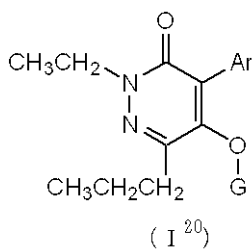
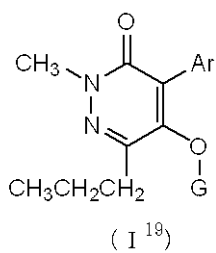
40

【0043】

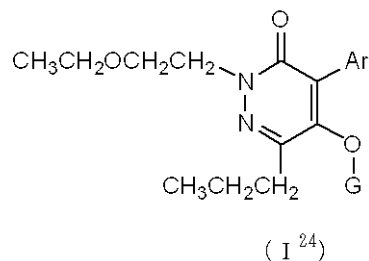
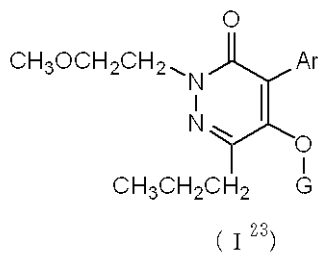
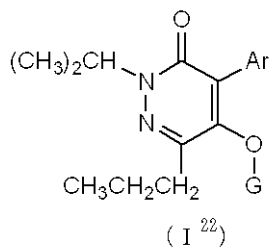


10

【 0 0 4 4 】

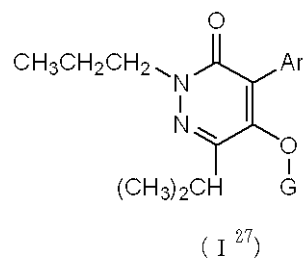
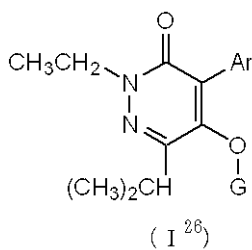
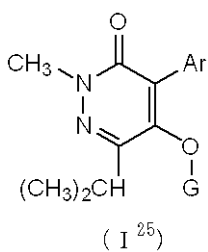


20

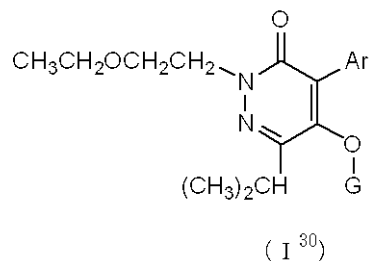
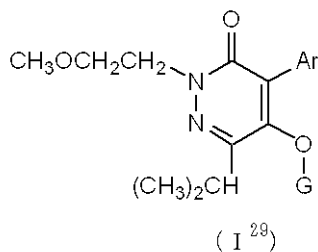
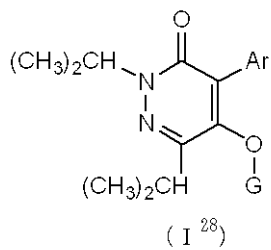


30

【 0 0 4 5 】



40



50

## 【 0 0 4 6 】

1) 一般式 ( I<sup>1</sup> ) ~ ( I<sup>30</sup> ) において、A r が 2 - エチルフェニル基であって、G が水素原子、アセチル基、トリフルオロアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、イソパレリル基、ピパロイル基、シクロヘキシルカルボニル基、ベンゾイル基、ベンジルカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、ベンゼンスルホニル基又は p - トルエンスルホニル基であるピリダジノン化合物。

## 【 0 0 4 7 】

2) 一般式 ( I<sup>1</sup> ) ~ ( I<sup>30</sup> ) において、A r が 2 - プロピルフェニル基であって、G が水素原子、アセチル基、トリフルオロアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、イソパレリル基、ピパロイル基、シクロヘキシルカルボニル基、ベンゾイル基、ベンジルカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、ベンゼンスルホニル基又は p - トルエンスルホニル基であるピリダジノン化合物。

10

## 【 0 0 4 8 】

3) 一般式 ( I<sup>1</sup> ) ~ ( I<sup>30</sup> ) において、A r が 2 , 4 - ジメチルフェニル基であって、G が水素原子、アセチル基、トリフルオロアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、イソパレリル基、ピパロイル基、シクロヘキシルカルボニル基、ベンゾイル基、ベンジルカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、ベンゼンスルホニル基又は p - トルエンスルホニル基であるピリダジノン化合物。

20

## 【 0 0 4 9 】

4) 一般式 ( I<sup>1</sup> ) ~ ( I<sup>30</sup> ) において、A r が 2 , 6 - ジメチルフェニル基であって、G が水素原子、アセチル基、トリフルオロアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、イソパレリル基、ピパロイル基、シクロヘキシルカルボニル基、ベンゾイル基、ベンジルカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、ベンゼンスルホニル基又は p - トルエンスルホニル基であるピリダジノン化合物。

30

## 【 0 0 5 0 】

5) 一般式 ( I<sup>1</sup> ) ~ ( I<sup>30</sup> ) において、A r が 2 - エチル - 4 - メチルフェニル基であって、G が水素原子、アセチル基、トリフルオロアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、イソパレリル基、ピパロイル基、シクロヘキシルカルボニル基、ベンゾイル基、ベンジルカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、ベンゼンスルホニル基又は p - トルエンスルホニル基であるピリダジノン化合物。

40

## 【 0 0 5 1 】

6) 一般式 ( I<sup>1</sup> ) ~ ( I<sup>30</sup> ) において、A r が 2 - エチル - 6 - メチルフェニル基であって、G が水素原子、アセチル基、トリフルオロアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、イソパレリル基、ピパロイル基、シクロヘキシルカルボニル基、ベンゾイル基、ベンジルカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、ベンゼンスルホニル基又は p - トルエンスルホニル基であるピリダジノン化合物。

50

## 【 0 0 5 2 】

7) 一般式 ( I<sup>1</sup> ) ~ ( I<sup>30</sup> ) において、A r が 2 , 6 - ジエチルフェニル基であって、G が水素原子、アセチル基、トリフルオロアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、イソパレリル基、ピパロイル基、シクロヘキシルカルボニル基、ベンゾイル基、ベンジルカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、ベンゼンスルホニル基又は p - トルエンスルホニル基であるピリダジノン化合物。

## 【 0 0 5 3 】

8) 一般式 ( I<sup>1</sup> ) ~ ( I<sup>30</sup> ) において、A r が 2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル基であって、

G が水素原子、アセチル基、トリフルオロアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、イソパレリル基、ピパロイル基、シクロヘキシルカルボニル基、ベンゾイル基、ベンジルカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、ベンゼンスルホニル基又は p - トルエンスルホニル基であるピリダジノン化合物。

## 【 0 0 5 4 】

9) 一般式 ( I<sup>1</sup> ) ~ ( I<sup>30</sup> ) において、A r が 2 - エチル - 4 , 6 - ジメチルフェニル基であって、

G が水素原子、アセチル基、トリフルオロアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、イソパレリル基、ピパロイル基、シクロヘキシルカルボニル基、ベンゾイル基、ベンジルカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、ベンゼンスルホニル基又は p - トルエンスルホニル基であるピリダジノン化合物。

## 【 0 0 5 5 】

10) 一般式 ( I<sup>1</sup> ) ~ ( I<sup>30</sup> ) において、A r が 2 , 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニル基であって、

G が水素原子、アセチル基、トリフルオロアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、イソパレリル基、ピパロイル基、シクロヘキシルカルボニル基、ベンゾイル基、ベンジルカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、ベンゼンスルホニル基又は p - トルエンスルホニル基であるピリダジノン化合物。

## 【 0 0 5 6 】

11) 一般式 ( I<sup>1</sup> ) ~ ( I<sup>30</sup> ) において、A r が 2 , 4 , 6 - トリエチルフェニル基であって、

G が水素原子、アセチル基、トリフルオロアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、イソパレリル基、ピパロイル基、シクロヘキシルカルボニル基、ベンゾイル基、ベンジルカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、ベンゼンスルホニル基又は p - トルエンスルホニル基であるピリダジノン化合物。

## 【 0 0 5 7 】

12) 一般式 ( I<sup>1</sup> ) ~ ( I<sup>30</sup> ) において、A r が 2 , 4 - ジエチルフェニル基であって、

G が水素原子、アセチル基、トリフルオロアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、イソパレリル基、ピパロイル基、シクロヘキシルカルボニル基、ベンゾイル基、ベンジルカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、ベンゼンスルホニル基又は p - トルエンスルホニル基であるピリダジノン化合物。

シカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、ベンゼンスルホニル基又は p - トルエンスルホニル基であるピリダジノン化合物。

【 0 0 5 8 】

1 3 ) 一般式 ( I<sup>1</sup> ) ~ ( I<sup>30</sup> ) において、A r が 2 , 4 - ジエチル - 6 - メチルフェニル基であって、

G が水素原子、アセチル基、トリフルオロアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、イソパレリル基、ピバロイル基、シクロヘキシルカルボニル基、ベンゾイル基、ベンジルカルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、メタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、ベンゼンスルホニル基又は p - トルエンスルホニル基であるピリダジノン化合物。

10

【 実施例 】

【 0 0 5 9 】

以下に製造例、製剤例及び試験例を示し、本発明をより具体的に説明するが、本発明はこれらの例に限定されない。

製造例中、室温とは通常 1 0 ~ 3 0 を示す。<sup>1</sup>H N M R とはプロトン核磁気共鳴スペクトルを示し、内部標準としてテトラメチルシランを用い、ケミカルシフト ( ) を p p m で表記した。

製造例中用いられている記号は次のような意味を有するものである。

20

C D C l<sub>3</sub> : 重クロロホルム、s : シングレット、d : ダブルレット、t : トリプレット、q : カルテット、d t : ダブルレットトリプレット、d q : ダブルレットカルテット、m : マルチプレット、b r . : ブロード ( 幅広い )、J : カップリング定数、Me : メチル基、Et : エチル基、Pr : プロピル基、i - Pr : イソプロピル基、t - Bu : ターシャリーブチル基、c - Hex : シクロヘキシル基、Ph : フェニル基。

【 0 0 6 0 】

製造例 1

4 - ( 2 - エチルフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 ( 2 H ) - ピリダジノン [ 化合物 I - a - 1 ]

4 - ( 2 - エチルフェニル ) - 5 - メトキシ - 2 - メチル - 3 ( 2 H ) - ピリダジノン [ 化合物 II - 1 ] 3 . 1 9 3 g に、水 5 0 m L、水酸化カリウム ( 8 5 % 含量 ) 4 . 6 5 7 g 及び 1 , 4 - ジオキサン 5 m L を加え、加熱還流下で 3 6 時間攪拌した。冷却後、反応混合物に濃塩酸を加えて酸性とし、水 1 0 m L 及び酢酸エチル 1 0 0 m L を加えた。該混合物における不溶物をろ別した後、分液した。有機層を、水、次いで飽和食塩水で洗浄した。該有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去した。得られた固体を酢酸エチル - ヘキサン混合溶媒 ( 1 : 2 ) で洗浄し、標記化合物 2 . 0 5 0 g を無色結晶として得た。

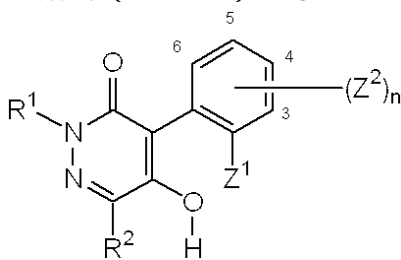
30

【 0 0 6 1 】

製造例 1 に準じて製造した化合物を、化合物 I - a - 1 と共に表 1 に示す。

一般式 ( I - a ) で示される化合物 :

40



( I - a )

【 0 0 6 2 】

【表 1】

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Z <sup>1</sup>	(Z <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	融点/°C
I-a-1	Me	H	Et	—	218-220
I-a-2	Et	H	Et	—	190-192
I-a-3	i-Pr	H	Et	—	226-227
I-a-4	MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	H	Et	—	137-139
I-a-5	Me	H	Pr	—	210-211
I-a-6	Me	H	Me	6-Me	267-271
I-a-7	Me	H	Et	6-Me	239-242
I-a-8	Me	H	Et	6-Et	247-249
I-a-9	Me	H	Me	4-Me	219-220
I-a-10	Me	H	Me	4-Me, 6-Me	272-275
I-a-11	Et	H	Me	4-Me, 6-Me	>300
I-a-12	Me	H	Et	4-Me, 6-Et	254-255

10

## 【 0 0 6 3 】

## 製造例 2

4 - ( 2 , 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 ( 2 H ) - ピリダジノン〔化合物 I - a - 1 4 〕

窒素雰囲気下、カリウム *tert* - ブトキシドのテトラヒドロフラン溶液 ( 1 mol / L ) 13 mL を室温で攪拌し、これに 2 - [ 2 - ( 2 , 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニルアセチル ) - 2 - メチルヒドラゾノ ] プロパン酸エチル〔化合物 VI - 2 〕 1.9 g のトルエン 55 mL 中の溶液を約 1 時間で滴下し、室温で更に 30 分間攪拌した。その後、反応混合物を減圧下に濃縮した。得られた残渣に氷水 30 mL を加え、*tert* - ブチルメチルエーテル ( 20 mL × 2 ) で抽出した。次に、水層に 35 % 塩酸 1.6 g を加えて酸性とし、酢酸エチル ( 20 mL × 3 ) で抽出した。酢酸エチル抽出液を合し、飽和食塩水 ( 20 mL × 2 ) で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー ( 酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 3 ) に付し、固体 0.76 g を得た。該固体を冷ヘキサンで洗浄し、風乾して、標記化合物 0.59 g を白色粉末として得た。

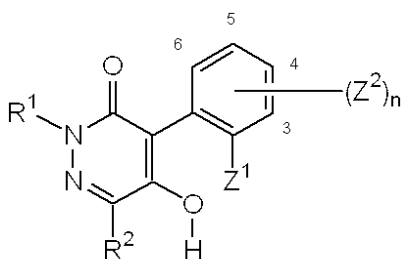
20

30

## 【 0 0 6 4 】

製造例 2 に準じて製造した化合物を、化合物 I - a - 1 4 と共に表 2 に示す。

一般式 ( I - a ) で示される化合物 :



( I - a )

## 【 0 0 6 5 】

40



【表 2】

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Z <sup>1</sup>	(Z <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	融点/°C
I-a-13	Me	Me	Me	4-Me, 6-Me	199-201
I-a-14	Me	Me	Et	4-Me, 6-Et	205-206
I-a-15	Me	Me	Et	—	171-172
I-a-16	Me	Me	Et	4-Me	187-188
I-a-17	Me	Me	Et	4-Et, 6-Et	188-190
I-a-18	Me	Me	Et	4-Me, 6-Me	176-177
I-a-19	Me	Et	Et	4-Me, 6-Et	194-195
I-a-20	Me	Et	Et	4-Me	148-149
I-a-21	Me	Et	Et	4-Me, 6-Me	188-189
I-a-22	Me	Et	Me	4-Me, 6-Me	210-211
I-a-23	Me	i-Pr	Et	4-Me, 6-Et	208-210
I-a-24	Me	Pr	Et	4-Me, 6-Et	175-176
I-a-25	Me	Et	Et	4-Et, 6-Et	170-171
I-a-26	Me	Pr	Et	4-Et, 6-Et	174-175
I-a-27	Me	Me	Et	4-Et	178-180
I-a-28	Me	Et	Et	4-Et	163-164
I-a-29	Me	Me	Et	4-Et, 6-Me	168-169
I-a-30	Me	Me	Et	6-Et	187-188

10

20

## 【0066】

## 製造例 3

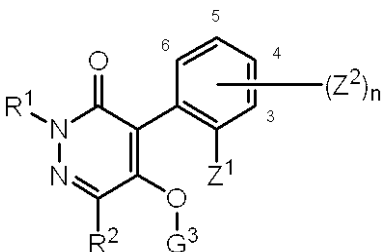
5 - ベンゾイルオキシ - 4 - ( 2 - エチルフェニル ) - 2 - メチル - 3 ( 2 H ) - ピリダジノン [ 化合物 I - b - 1 ]

製造例 1 で製造した化合物 I - a - 1 0 . 3 2 6 g に、テトラヒドロフラン 1 2 m L 及びトリエチルアミン 0 . 4 0 m L を加え、氷冷し、更に塩化ベンゾイル 0 . 2 5 m L を加えた。氷冷下で 1 0 分間、次いで室温で 3 時間攪拌を行った。反応混合物に水 3 0 m L を加え、酢酸エチル 3 0 m L で 2 回抽出した。抽出液を合し、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン = 1 : 2 2 : 1）に付し、標記化合物 0 . 4 6 3 g を無色オイルとして得た。

30

## 【0067】

製造例 3 に準じて製造した化合物を、化合物 I - b - 1 と共に表 3 に示す。  
一般式 ( I - b ) で示される化合物：



( I - b )

## 【0068】

40

【表 3】

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Z <sup>1</sup>	(Z <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	G <sup>3</sup>	融点/°C
I-b-1	Me	H	Et	—	COPh	*
I-b-2	Me	H	Et	—	COMe	69-70
I-b-3	Me	H	Et	—	COEt	*
I-b-4	Me	H	Et	—	COi-Pr	77-79
I-b-5	Me	H	Et	—	COt-Bu	56-59
I-b-6	Me	H	Et	—	COc-Hex	*
I-b-7	Me	H	Et	—	CO <sub>2</sub> Me	81-82
I-b-8	Me	H	Et	—	CONMe <sub>2</sub>	*
I-b-9	Me	H	Et	—	SO <sub>2</sub> Me	*
I-b-10	Me	H	Pr	—	COMe	78-79
I-b-11	Me	H	Me	4-Me, 6-Me	COt-Bu	93-96
I-b-12	Me	H	Et	4-Me, 6-Et	COMe	99-101
I-b-13	Me	Me	Me	4-Me, 6-Me	COMe	130-131
I-b-14	Me	Me	Et	4-Me, 6-Et	COMe	133-134
I-b-15	Me	Me	Et	4-Me, 6-Et	COt-Bu	105-106
I-b-16	Me	Me	Et	—	COMe	148-149
I-b-17	Me	Me	Et	—	COt-Bu	89
I-b-18	Me	Me	Et	4-Me, 6-Et	CO <sub>2</sub> Et	73-74
I-b-19	Me	Me	Et	4-Me, 6-Et	COPh	145-146
I-b-20	Me	Me	Et	4-Me	COMe	142-143
I-b-21	Me	Me	Et	4-Et, 6-Et	COMe	103-104
I-b-22	Me	Me	Et	4-Me, 6-Me	COMe	106-107
I-b-23	Me	Me	Et	4-Me, 6-Et	COEt	103-104
I-b-24	Me	Me	Et	4-Me, 6-Et	COi-Pr	102-103
I-b-25	Me	Me	Et	4-Me, 6-Et	CO <sub>2</sub> Me	95-96
I-b-26	Me	Me	Et	4-Me, 6-Et	CO <sub>2</sub> Ph	105
I-b-27	Me	Me	Et	4-Me, 6-Et	SO <sub>2</sub> Me	153-154
I-b-28	Me	Me	Et	4-Me, 6-Et	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	63-67
I-b-29	Me	Et	Et	4-Me, 6-Et	COMe	133-134
I-b-30	Me	Pr	Et	4-Me, 6-Et	COMe	161-162
I-b-31	Me	i-Pr	Et	4-Me, 6-Et	COMe	159-160
I-b-32	Me	Et	Et	4-Et, 6-Et	COMe	117-118
I-b-33	Me	Me	Et	4-Et	COMe	115-116
I-b-34	Me	Me	Et	6-Et	COMe	127-128
I-b-35	Me	Me	Et	4-Me, 6-Me	CO <sub>2</sub> Et	65-67

10

20

30

40

## 【 0 0 6 9 】

表 3 の中で融点の欄に \* を付した化合物についてそれらの<sup>1</sup>H NMR データを以下に示す。

化合物 I - b - 1 :

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm : 1.14 (3H, t, J = 7.7 Hz), 2.45 - 2.62 (2H, m), 3.88 (3H, s), 7.09 - 7.12 (1H, m),

50

7.15 - 7.20 (1H, m), 7.28 - 7.30 (2H, m), 7.37 - 7.42 (2H, m), 7.55 - 7.60 (1H, m), 7.81 - 7.84 (2H, m), 7.95 (1H, s)。

化合物 I - b - 3 :

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm : 0.94 (3H, t, J = 7.6 Hz), 1.13 (3H, t, J = 7.7 Hz), 2.27 (2H, dq, J = 1.4, 7.6 Hz), 2.38 - 2.56 (2H, m), 3.84 (3H, s), 7.00 - 7.03 (1H, m), 7.18 - 7.23 (1H, m), 7.30 - 7.35 (2H, m), 7.75 (1H, s)。

化合物 I - b - 6 :

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm : 1.13 (3H, t, J = 7.7 Hz), 1.10 - 1.22 (5H, m), 1.5 - 1.7 (5H, m), 2.28 (1H, br.), 2.38 - 2.55 (2H, m), 3.84 (3H, s), 6.99 - 7.02 (1H, m), 7.17 - 7.22 (1H, m), 7.29 - 7.36 (2H, m), 7.72 (1H, s)。

化合物 I - b - 8 :

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm : 1.11 (3H, t, J = 7.7 Hz), 2.40 - 2.57 (2H, m), 2.64 (3H, s), 2.85 (3H, s), 3.83 (3H, s), 7.05 - 7.08 (1H, m), 7.19 - 7.24 (1H, m), 7.30 - 7.36 (2H, m), 7.95 (1H, s)。

化合物 I - b - 9 :

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm : 1.18 (3H, t, J = 7.6 Hz), 2.43 - 2.57 (2H, m), 2.58 (3H, s), 3.85 (3H, s), 7.16 - 7.19 (1H, m), 7.25 - 7.30 (1H, m), 7.36 - 7.43 (2H, m), 7.96 (1H, s)。

【0070】

一般式 (II) で示される化合物の代表的な製造例を参考例 1 に示す。

参考例 1

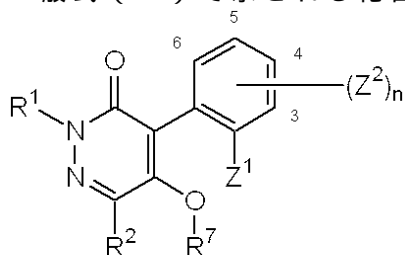
4 - (2 - エチルフェニル) - 5 - メトキシ - 2 - メチル - 3 (2H) - ピリダジノン [化合物 II - 1]

4 - クロロ - 5 - メトキシ - 2 - メチル - 3 (2H) - ピリダジノン 2.516 g、2 - エチルフェニルボロン酸 2.575 g 及び炭酸ナトリウム 3.333 g の混合物に、1, 4 - ジオキサン 30 mL 及び水 20 mL を加え、更に臭化テトラブチルアンモニウム 2.417 g 及びテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム 0.657 g を加え、窒素雰囲気且つ加熱還流下で 17 時間攪拌を行った。反応混合物を冷却後、水 50 mL を加え、酢酸エチル 100 mL、さらに 30 mL で抽出した。抽出液を合し、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を留去した。得られた固体を酢酸エチル - ヘキサン混合溶媒 (1 : 2) で洗浄し、標記化合物 3.238 g を黄色結晶として得た。

【0071】

参考例 1 に準じて製造した一般式 (II) で示される化合物を、化合物 II - 1 と共に表 4 に示す。

一般式 (II) で示される化合物 :



(II)

10

20

30

40

50

【 0 0 7 2 】

【 表 4 】

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Z <sup>1</sup>	(Z <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>7</sup>	融点/°C
II-1	Me	H	Et	—	Me	127-130
II-2	Et	H	Et	—	Me	*
II-3	i-Pr	H	Et	—	Me	121-123
II-4	MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	H	Et	—	Me	*
II-5	Me	H	Pr	—	Me	86-88
II-6	Me	H	Me	6-Me	Me	187-189
II-7	Me	H	Et	6-Me	Me	*
II-8	Me	H	Et	6-Et	Me	165-166
II-9	Me	H	Me	4-Me	Me	141-142
II-10	Me	H	Me	4-Me, 6-Me	Me	186-192
II-11	Et	H	Me	4-Me, 6-Me	Me	100-102
II-12	Me	H	Et	4-Me, 6-Et	Me	147-149

10

【 0 0 7 3 】

20

表 4 の中で融点の欄に \* を付した化合物についてそれらの<sup>1</sup>H NMR データを以下に示す。

化合物 II - 2 :

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm: 1.12 (3H, t, J = 7.7 Hz), 1.39 (3H, t, J = 7.3 Hz), 2.40 - 2.53 (2H, m), 3.81 (3H, s), 4.19 - 4.30 (2H, m), 7.10 (1H, d, J = 7.6 Hz), 7.21 - 7.26 (1H, m), 7.30 - 7.33 (2H, m), 7.88 (1H, s)

化合物 II - 4 :

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm: 1.12 (3H, t, J = 7.7 Hz), 2.38 - 2.52 (2H, m), 3.38 (3H, s), 3.82 (3H, s), 3.77 - 3.84 (2H, m), 4.40 (2H, t, J = 5.6 Hz), 7.11 (1H, d, J = 7.6 Hz), 7.21 - 7.26 (1H, m), 7.30 - 7.34 (2H, m), 7.90 (1H, s)。

化合物 II - 7 :

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm: 1.08 (3H, t, J = 7.7 Hz), 2.07 (3H, s), 2.30 - 2.45 (2H, m), 3.81 (3H, s), 3.82 (3H, s), 7.10 (1H, d, J = 7.6 Hz), 7.13 (1H, d, J = 7.6 Hz), 7.24 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.85 (1H, s)。

【 0 0 7 4 】

40

一般式 (V - a) で示される化合物の代表的な製造例を参考例 2 に示す。

参考例 2

## 2 - プロピルフェニルボロン酸

ブチルリチウム (1.6 mol/L ヘキサン溶液) 15.5 mL を反応容器に入れ、ドライアイス - アセトン浴により冷却し、ここにテトラヒドロフラン 45 mL に溶解した 2 - プロピルプロモベンゼン 4.412 g を窒素雰囲気下、-70 で 85 分間かけて滴下した。該混合物を、-70 で 30 分間攪拌後、ホウ酸トリメチル 3.75 mL を -70 で 15 分間で滴下した。該混合物を -70 で 1 時間攪拌後、ドライアイス - アセトン浴による冷却を停止し、その後室温で 18 時間攪拌した。反応混合物に 2 N 塩酸 33 mL を 10 分間で滴下し、その後室温で 4 時間攪拌を行った。該混合物に水 20 mL を加え、

50

酢酸エチル 70 mL で抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン = 1 : 2 : 2 : 1）に付し、標記化合物 1.641 g を無色結晶として得た。

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm : 1.01 (3H, t, J = 7.4 Hz), 1.69 - 1.79 (2H, m), 3.15 - 3.20 (2H, m), 4.0 - 6.0 (2H, br.), 7.28 - 7.33 (2H, m), 7.47 (1H, dt, J = 1.5, 7.6 Hz), 8.20 - 8.23 (1H, m)。

【0075】

参考例 2 に準じて、以下の一般式 (V - a) で示される化合物を製造した。

2 - エチル - 6 - メチルフェニルボロン酸 :

mp 90 ~ 91、

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm : 1.22 (3H, t, J = 7.6 Hz), 2.35 (3H, s), 2.64 (2H, q, J = 7.6 Hz), 4.0 - 5.5 (2H, br.), 6.98 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.01 (1H, d, J = 7.7 Hz), 7.18 (1H, t, J = 7.7 Hz)。

2, 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニルボロン酸 :

mp 111 ~ 113、

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm : 1.23 (6H, t, J = 7.7 Hz), 2.31 (3H, s), 2.63 (4H, q, J = 7.7 Hz), 4.0 - 5.0 (2H, br.), 6.88 (2H, s)。

【0076】

一般式 (VI) で示される化合物の代表的な製造例を参考例 3 に示す。

参考例 3

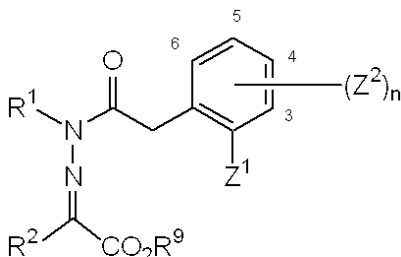
2 - [2 - (2, 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニルアセチル) - 2 - メチルヒドラゾノ] プロパン酸エチル [化合物 VI - 2]

2 - (メチルヒドラゾノ) プロパン酸エチル 2.0 g のアセトニトリル 35 mL 中の溶液に、炭酸カリウム 1.5 g を加えた。該混合物を氷冷下に攪拌し、これに 2, 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニルアセチルクロリド 2.6 g のアセトニトリル 10 mL 中の溶液を約 20 分間で滴下し、室温で更に 3.5 時間攪拌した。その後、反応混合物を減圧下に濃縮した。得られた残渣に氷水 20 mL を加え、酢酸エチル (20 mL × 3) で抽出した。抽出液を合し、飽和食塩水 (20 mL × 2) で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣を塩基性アルミナカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン = 1 : 3）に付し、標記化合物 1.9 g を白色結晶として得た。

【0077】

参考例 3 に準じて製造した一般式 (VI) で示される化合物を、化合物 VI - 2 と共に表 5 に示す。

一般式 (VI) で示される化合物 :



(VI)

【0078】

10

20

30

40

【表5】

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Z <sup>1</sup>	(Z <sup>2</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>9</sup>	融点/°C
VI-1	Me	Me	Me	4-Me, 6-Me	Et	90-91
VI-2	Me	Me	Et	4-Me, 6-Et	Et	73-76
VI-3	Me	Me	Et	—	Et	*
VI-4	Me	Me	Et	4-Me	Et	*
VI-5	Me	Me	Et	4-Et, 6-Et	Et	63-66
VI-6	Me	Me	Et	4-Me, 6-Me	Et	*
VI-7	Me	Et	Et	4-Me, 6-Et	Et	*
VI-8	Me	Et	Et	4-Me	Et	*
VI-9	Me	Et	Et	4-Me, 6-Me	Et	*
VI-10	Me	Et	Me	4-Me, 6-Me	Et	*
VI-11	Me	i-Pr	Et	4-Me, 6-Et	Et	*
VI-12	Me	Pr	Et	4-Me, 6-Et	Et	*
VI-13	Me	Et	Et	4-Et, 6-Et	Et	*
VI-14	Me	Pr	Et	4-Et, 6-Et	Et	*
VI-15	Me	Me	Et	4-Et	Et	*
VI-16	Me	Et	Et	4-Et	Et	*
VI-17	Me	Me	Et	4-Et, 6-Me	Et	*
VI-18	Me	Me	Et	6-Et	Et	*

10

20

## 【0079】

表5の中で融点の欄に\*を付した化合物についてそれらの<sup>1</sup>H NMRデータを以下に示す。

化合物VI-3:

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm: 1.19 (3H, t, J = 7.6 Hz), 1.37 (3H, t, J = 7.2 Hz), 2.20 (3H, br. s), 2.67 (2H, q, J = 7.7 Hz), 3.37 (3H, br. s), 4.03 (2H, br. s), 4.33 (2H, q, J = 7.0 Hz), 7.06 - 7.30 (4H, m)。

30

化合物VI-4:

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm: 1.18 (3H, t, J = 7.6 Hz), 1.37 (3H, t, J = 7.2 Hz), 2.20 (3H, br. s), 2.30 (3H, s), 2.63 (2H, q, J = 7.7 Hz), 3.36 (3H, br. s), 3.99 (2H, br. s), 4.33 (2H, q, J = 7.1 Hz), 6.93 (1H, br. d, J = 7.1 Hz), 7.00 (1H, br. s), 7.12 (1H, br. d, J = 7.8 Hz)。

40

化合物VI-6:

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm: 1.16 (3H, t, J = 7.7 Hz), 1.36 (3H, t, J = 7.2 Hz), 2.22 (3H, s), 2.27 (3H, s), 2.30 (3H, br. s), 2.56 (2H, q, J = 7.7 Hz), 3.39 (3H, br. s), 4.02 (2H, br. s), 4.32 (2H, q, J = 7.1 Hz), 6.86 (2H, br. s)。

化合物VI-7 (E/Z異性体混合物):

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm: 1.13 ~ 1.25 (9H, m), 1.31 ~ 1.41 (3H, m), 2.29 (3H, s), 2.50 ~ 2.81 (6H, m), 3.23, 3.43 (3H, each br. s), 4.05 (2H, br. s), 4.27 ~ 4.39 (2H, m), 6.89 (2H, s)。

50

化合物VI - 8 ( E / Z 異性体混合物 ) :

$^1\text{H}$  NMR (  $\text{CDCl}_3$  ) ppm : 1 . 0 6 ~ 1 . 2 2 ( 6 H , m ) , 1 . 3 1 ~ 1 . 4 0 ( 3 H , m ) , 2 . 3 0 , 2 . 3 1 ( 3 H , e a c h s ) , 2 . 5 0 ~ 2 . 7 0 ( 4 H , m ) , 3 . 2 2 , 3 . 3 8 ( 3 H , e a c h s ) , 4 . 0 0 ( 2 H , b r . s ) , 4 . 2 7 ~ 4 . 3 7 ( 2 H , m ) , 6 . 9 0 ~ 6 . 9 8 ( 1 H , m ) , 6 . 9 8 ~ 7 . 0 2 ( 1 H , m ) , 7 . 0 2 ~ 7 . 1 4 ( 1 H , m ) 。

化合物VI - 9 ( E / Z 異性体混合物 ) :

$^1\text{H}$  NMR (  $\text{CDCl}_3$  ) ppm : 1 . 1 2 ~ 1 . 2 5 ( 6 H , m ) , 1 . 3 1 ~ 1 . 4 1 ( 3 H , m ) , 2 . 2 2 ( 3 H , s ) , 2 . 2 7 ( 3 H , s ) , 2 . 5 0 ~ 2 . 8 1 ( 4 H , m ) , 3 . 2 3 , 3 . 4 3 ( 3 H , e a c h b r . s ) , 4 . 0 2 ( 2 H , b r . s ) , 4 . 2 6 ~ 4 . 3 7 ( 2 H , m ) , 6 . 8 7 ( 2 H , b r . s ) 。

化合物VI - 10 ( E / Z 異性体混合物 ) :

$^1\text{H}$  NMR (  $\text{CDCl}_3$  ) ppm : 1 . 1 6 ~ 1 . 2 4 ( 3 H , m ) , 1 . 3 2 ~ 1 . 4 0 ( 3 H , m ) , 2 . 2 2 ( 6 H , s ) , 2 . 2 5 ( 3 H , s ) , 2 . 5 5 ~ 2 . 8 0 ( 2 H , m ) , 3 . 2 3 , 3 . 4 3 ( 3 H , e a c h b r . s ) , 4 . 0 0 ( 2 H , b r . s ) , 4 . 2 7 ~ 4 . 3 8 ( 2 H , m ) , 6 . 8 5 ( 2 H , s ) 。

化合物VI - 11 :

$^1\text{H}$  NMR (  $\text{CDCl}_3$  ) ppm : 1 . 1 8 ( 6 H , t , J = 7 . 6 H z ) , 1 . 2 4 ( 6 H , d , J = 6 . 8 H z ) , 1 . 3 7 ( 3 H , t , J = 7 . 1 H z ) , 2 . 2 9 ( 3 H , s ) , 2 . 5 5 ( 4 H , q , J = 7 . 6 H z ) , 2 . 8 5 ( 1 H , s e p t e t , J = 6 . 8 H z ) , 3 . 2 2 ( 3 H , s ) , 4 . 0 4 ( 2 H , s ) , 4 . 3 4 ( 2 H , q , J = 7 . 2 H z ) , 6 . 8 8 ( 2 H , s ) 。

化合物VI - 12 ( E / Z 異性体混合物 ) :

$^1\text{H}$  NMR (  $\text{CDCl}_3$  ) ppm : 1 . 0 1 ( 3 H , t , J = 7 . 4 H z ) , 1 . 1 7 ( 6 H , t , J = 7 . 6 H z ) , 1 . 3 1 ~ 1 . 4 0 ( 3 H , m ) , 1 . 5 7 ~ 1 . 7 4 ( 2 H , m ) , 2 . 3 0 ( 3 H , s ) , 2 . 5 0 ~ 2 . 7 6 ( 6 H , m ) , 3 . 2 2 , 3 . 4 2 ( 3 H , e a c h s ) , 4 . 0 3 , 4 . 0 5 ( 2 H , e a c h b r . s ) , 4 . 2 6 ~ 4 . 3 6 ( 2 H , m ) , 6 . 8 9 ( 2 H , s ) 。

化合物VI - 13 ( E / Z 異性体混合物 ) :

$^1\text{H}$  NMR (  $\text{CDCl}_3$  ) ppm : 1 . 1 3 ~ 1 . 2 8 ( 1 2 H , m ) , 1 . 3 0 ~ 1 . 4 0 ( 3 H , m ) , 2 . 5 0 ~ 2 . 8 0 ( 8 H , m ) , 3 . 2 3 , 3 . 4 4 ( 3 H , e a c h s ) , 4 . 0 6 ( 2 H , b r . s ) , 4 . 2 8 ~ 4 . 3 9 ( 2 H , m ) , 6 . 9 1 ( 2 H , s ) 。

化合物VI - 14 ( E / Z 異性体混合物 ) :

$^1\text{H}$  NMR (  $\text{CDCl}_3$  ) ppm : 1 . 0 1 ( 3 H , b r . t , J = 7 . 2 H z ) , 1 . 1 3 ~ 1 . 2 6 ( 9 H , m ) , 1 . 3 0 ~ 1 . 4 0 ( 3 H , m ) , 1 . 5 6 ~ 1 . 7 3 ( 2 H , m ) , 2 . 5 0 ~ 2 . 7 6 ( 8 H , m ) , 3 . 2 2 , 3 . 4 2 ( 3 H , e a c h s ) , 4 . 0 3 , 4 . 0 6 ( 2 H , e a c h b r . s ) , 4 . 2 6 ~ 4 . 3 7 ( 2 H , m ) , 6 . 9 1 ( 2 H , s ) 。

化合物VI - 15 :

$^1\text{H}$  NMR (  $\text{CDCl}_3$  ) ppm : 1 . 1 5 ~ 1 . 2 5 ( 6 H , m ) , 1 . 3 7 ( 3 H , t , J = 7 . 2 H z ) , 2 . 2 0 ( 3 H , b r . s ) , 2 . 5 5 ~ 2 . 7 0 ( 4 H , m ) , 3 . 3 6 ( 3 H , b r . s ) , 3 . 9 9 ( 2 H , b r . s ) , 4 . 3 3 ( 2 H , q , J = 7 . 1 H z ) , 6 . 9 6 ( 1 H , b r . d , J = 7 . 3 H z ) , 7 . 0 2 ( 1 H , b r . s ) , 7 . 1 5 ( 1 H , b r . d , J = 7 . 8 H z ) 。

化合物VI - 16 ( E / Z 異性体混合物 ) :

$^1\text{H}$  NMR (  $\text{CDCl}_3$  ) ppm : 1 . 0 5 ~ 1 . 2 5 ( 9 H , m ) , 1 . 3 2 ~ 1 . 4 0 ( 3 H , m ) , 2 . 5 0 ~ 2 . 6 9 ( 6 H , m ) , 3 . 2 2 , 3 . 3 8 ( 3 H , e a c h s ) , 4 . 0 0 ( 2 H , b r . s ) , 4 . 2 6 ~ 4 . 3 6 ( 2 H , m ) , 6 . 9 3 ~ 7 . 0 0 ( 1 H , m ) , 7 . 0 0 ~ 7 . 0 4 ( 1 H , m ) , 7 . 0 6 ~ 7 . 1 8 ( 1

10

20

30

40

50

H, m)。

化合物VI - 17 :

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm : 1.17 (3H, t, J = 7.6 Hz), 1.22 (3H, t, J = 7.6 Hz), 1.36 (3H, t, J = 7.1 Hz), 2.24 (3H, s), 2.30 (3H, br. s), 2.58 (4H, q, J = 7.6 Hz), 3.40 (3H, br. s), 4.03 (2H, br. s), 4.32 (2H, q, J = 7.2 Hz), 6.89 (2H, s)。

化合物VI - 18 :

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm : 1.19 (6H, t, J = 7.6 Hz), 1.36 (3H, t, J = 7.2 Hz), 2.32 (3H, br. s), 2.60 (4H, q, J = 7.7 Hz), 3.40 (3H, br. s), 4.09 (2H, br. s), 4.33 (2H, q, J = 7.2 Hz), 7.07 (2H, d, J = 7.6 Hz), 7.18 (1H, t, J = 7.6 Hz)。

【0080】

以下、製剤例を示す。

製剤例 1

フロアブル剤

化合物 I - a - 1	10 重量%
化合物 B	10 重量%
ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート	3 重量%
CMC (カルボキシメチルセルロース)	3 重量%
水	74 重量%

を混合し、粒度が5ミクロン以下になるまで湿式粉碎して、フロアブル剤を得る。

化合物 I - a - 1 に代えて、同様にして化合物 I - a - 2 ~ I - a - 30 及び I - b - 1 ~ I - b - 35 の各々のフロアブル剤を得る。

【0081】

製剤例 2

水和剤

化合物 I - b - 2	25 重量%
化合物 B	25 重量%
リグニンスルホン酸ナトリウム	5 重量%
ポリオキシエチレンアルキルエーテル	5 重量%
ホワイトカーボン	5 重量%
クレイ	35 重量%

を混合粉碎して水和剤を得る。調製した水和剤は水で適宜希釈して使用する。

化合物 I - b - 2 に代えて、同様にして化合物 I - a - 1 ~ I - a - 30、I - b - 1、及び、I - b - 3 ~ I - b - 35 の各々の水和剤を得る。

【0082】

製剤例 3

粒剤

化合物 I - b - 20	1 重量%
化合物 B	1 重量%
リグニンスルホン酸ナトリウム	2 重量%
タルク	40 重量%
ベントナイト	56 重量%

を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して粒剤を得る。

化合物 I - b - 20 に代えて、同様にして化合物 I - a - 1 ~ I - a - 30、I - b - 1 ~ I - b - 19、及び、I - b - 21 ~ I - b - 35 の各々の粒剤を得る。

【0083】

10

20

30

40

50



## 製剤例 4

## フロアブル剤

化合物 I - a - 1 4	3 0 重量 %
化合物 B	3 重量 %
ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート	3 重量 %
C M C (カルボキシメチルセルロース)	3 重量 %
水	6 1 重量 %

を混合し、粒度が5ミクロン以下になるまで湿式粉碎して、フロアブル剤を得る。

化合物 I - a - 1 4 に代えて、同様にして化合物 I - a - 1 ~ I - a - 1 3、I - a - 1 5 ~ I - a - 3 0、及び、I - b - 1 ~ I - b - 3 5 の各々のフロアブル剤を得る。

【0084】

## 製剤例 5

## 水和剤

化合物 I - b - 4	5 重量 %
化合物 B	5 0 重量 %
リグニンスルホン酸ナトリウム	5 重量 %
ポリオキシエチレンアルキルエーテル	5 重量 %
ホワイトカーボン	5 重量 %
クレイ	3 0 重量 %

を混合粉碎して水和剤を得る。調製した水和剤は水で適宜希釈して使用する。

化合物 I - b - 4 に代えて、同様にして化合物 I - a - 1 ~ I - a - 3 0、I - b - 1 ~ I - b - 3、及び、I - b - 5 ~ I - b - 3 5 の各々の水和剤を得る。

【0085】

## 製剤例 6

## 粒剤

化合物 I - a 1 7	5 重量 %
化合物 B	1 重量 %
リグニンスルホン酸ナトリウム	2 重量 %
タルク	4 0 重量 %
ベントナイト	5 2 重量 %

を混合し、水を加えて練り合わせ造粒して粒剤を得る。

化合物 I - a - 1 7 に代えて、同様にして化合物 I - a - 1 ~ I - a - 1 6、I - a - 1 8 ~ I - a - 3 0、及び、I - b - 1 ~ I - b - 3 5 の各々の粒剤を得る。

【0086】

## 製剤例 7

本化合物 ( I - a - 1 2 ) 5 部と、化合物 B 5 部と、下記の A 群から選ばれる化合物いずれか 1 種 1 0 部とを、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 2 0 部および珪藻土 5 4 部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して水和剤を得る。

【0087】

## A 群：

フェノキシ脂肪酸系除草性化合物 [ M C P、M C P B、フェノチオール ( p h e n o t h i o 1 )、メコプロップ ( m e c o p r o p )、フルロキシビル ( f l u r o x y p y r )、トリクロピル ( t r i c l o p y r )、クロメプロップ ( c l o m e p r o p )、ナプロアニリド ( n a p r o a n i l i d e ) ]、

安息香酸系除草性化合物 [ 2 , 3 , 6 - T B A、クロピラリド ( c l o p y r a l i d )、ピクロラム ( p i c l o r a m )、アミノピラリド ( a m i n o p y r a l i d )、キンクロラック ( q u i n c l o r a c )、キンメラック ( q u i n m e r a c ) ]、

尿素系除草性化合物 [ ジウロン ( d i u r o n )、リニユロン ( l i n u r o n )、クロルトロン ( c h l o r t o l u r o n )、イソプロツロン ( i s o p r o t u r o n )

10

20

30

40

50

)、フルオメツロン (fluometuron)、イソウロン (isouron)、テブチウロン (tebuthiuron)、メタバズチアズロン (methabenzthiazuron)、クミルロン (cumyluron)、ダイムロン (daimuron)、メチルダイムロン (methyl-daimuron) ]、

トリアジン系除草性化合物 [ アメトリン (ametoryn)、シアナジン (cyanazine)、シマジン (simazine)、プロバジン (propazine)、シメトリン (simetryn)、ジメタメトリン (dimethametryn)、プロメトリン (prometryn)、メトリブジン (metribuzin)、トリアジフラム (triaziflam) ]、

ビピリジニウム系除草性化合物 [ パラコート (paraquat)、ジクワット (diquat) ]、

ヒドロキシベンゾニトリル系除草性化合物 [ プロモキシニル (bromoxynil)、アイオキシニル (ioxynil) ]、

ジニトロアニリン系除草性化合物 [ ペンディメタリン (pendimethalin)、プロジアミン (prodiamine)、トリフルラリン (trifluralin) ]、

有機リン系除草性化合物 [ アミプロホスメチル (amiprofos-methyl)、ブタミホス (butamifos)、ベンスリド (bensulide)、ピペロホス (piperophos)、アニロホス (anilofos)、グルホシネート (glufosinate)、ビアラホス (bialaphos) ]、

カーバメート系除草性化合物 [ ジアレート (di-allate)、トリアレート (tri-allate)、EPTC、ブチレート (butylate)、ベンチオカーブ (benthio carb)、エスプロカルブ (esprocarb)、モリネート (molinate)、ジメピペレート (dimepiperate)、スエップ (swep)、クロルプロファム (chlorpropham)、フェンメディファム (phenmedipham)、フェニソファム (phenisopham)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、アシュラム (asulam) ]、

酸アミド系除草性化合物 [ プロパニル (propanil)、プロピザミド (propyzamide)、ブロモブチド (bromobutide)、エトベンザニド (etobenzanid) ]、

クロロアセトアニリド系除草性化合物 [ アラクロール (alachlor)、ブタクロール (butachlor)、ジメテナミド (dimethenamid)、プロパクロール (propachlor)、メタザクロール (metazachlor)、プレチラクロール (pretilachlor)、テニルクロール (thenylchlor)、ペトキサミド (pethoxamid) ]、

ジフェニルエーテル系除草性化合物 [ アシフルオルフェン (acifluorfen-sodium)、ピフェノックス (bifenox)、オキシフルオルフェン (oxyfluorfen)、ラクトフェン (lactofen)、フォメサフェン (fomesafen)、クロメトキシニル (chlomethoxynil)、アクロニフェン (aclonifen) ]、

環状イミド系除草性化合物 [ オキサジアゾン (oxadiazon)、シニドンエチル (cinidon-ethyl)、カルフェントラゾンエチル (carfentrazone-ethyl)、スルフェントラゾン (sulfentrazone)、フルミクロラックペンチル (flumiclorac-pentyl)、ピラフルフェンエチル (pyraflufen-ethyl)、オキサジアルギル (oxadiargyl)、ペントキサゾン (pentoxazone)、フルチアセットメチル (fluthiacet-methyl)、ブタフェナシル (butafenacil)、ベンズフェンジゾン (benzflendizone) ]、

ピラゾール系除草性化合物 [ ベンゾフェナップ (benzofenap)、ピラゾレート (pyrazolate)、ピラゾキシフェン (pyrazoxyfen)、トブラメ

10

20

30

40

50

ゾン (topramezone)、ピラスルフートール (pyrasulfotole) ]

、  
トリケトン系除草性化合物 [イソキサフルトール (isoxaflutole)、ベンゾビシクロン (benzobicyclon)、スルコトリオン (sulcotrione)、メソトリオン (mesotrione)、テンボトリオン (tembotrione)、テフリルトリオン (tefuryltrione) ]、

アリールオキシフェノキシプロピオン酸系除草性化合物 [シハロホップブチル (cyhalofop-butyl)、ジクロホップメチル (diclofop-methyl)、フェノキサプロップエチル (fenoxaprop-ethyl)、フルアジホップブチル (fluazifop-butyl)、ハロキシホップメチル (haloxyfop-methyl)、キザロホップエチル (quizalofop-ethyl)、メタミホップ (metamifop) ]、

トリオンオキシム系除草性化合物 [アロキシジム (alloxydim-sodium)、セトキシジム (sethoxydim)、ブトロキシジム (butoxydim)、クレソジム (clethodim)、クロプロキシジム (cloproxydim)、シクロキシジム (cycloxydim)、テプラロキシジム (tepraloxym)、トラルコキシジム (tralkoxydim)、プロフォキシジム (profoxydim) ]、

スルホニル尿素系除草性化合物 [クロルスルフロン (chlorsulfuron)、スルホメツロンメチル (sulfometuron-methyl)、メトスルフロンメチル (metsulfuron-methyl)、トリベニユロンメチル (tribenuron-methyl)、トリアスルフロン (triasulfuron)、ベンスルフロンメチル (bensulfuron-methyl)、チフェンスルフロンメチル (thifensulfuron-methyl)、ピラゾスルフロンエチル (pyrazosulfuron-ethyl)、プリミスルフロンメチル (primisulfuron-methyl)、ニコスルフロン (nicosulfuron)、アミドスルフロン (amidosulfuron)、シノスルフロン (cinosulfuron)、イマゾスルフロン (imazosulfuron)、リムスルフロン (rimsulfuron)、ハロスルフロンメチル (halosulfuron-methyl)、プロスルフロン (prosulfuron)、エタメトスルフロンメチル (ethametsulfuron-methyl)、トリフルスルフロンメチル (triflurosulfuron-methyl)、フラザスルフロン (flazasulfuron)、シクロスルフアムロン (cyclosulfamuron)、フルピルスルフロン (flupyrsulfuron)、スルホスルフロン (sulfosulfuron)、アジムスルフロン (azimsulfuron)、エトキシスルフロン (ethoxysulfuron)、オキサスルフロン (oxasulfuron)、ヨードスルフロンメチルナトリウム (iodosulfuron-methyl-sodium)、フォラムスルフロン (foramsulfuron)、メソスルフロンメチル (mesosulfuron-methyl)、トリフロキシスルフロン (trifloxysulfuron)、トリトスルフロン (tritoflurosulfuron)、オルソスルフアムロン (orthosulfamuron)、フルセトスルフロン (flucetosulfuron) ]、

イミダゾリノン系除草性化合物 [イマザメタベンズメチル (imazamethabenz-methyl)、イマザメタピル (imazamethapyr)、イマザモックス (imazamox)、イマザピル (imazapyr)、イマザキン (imazaquin)、イマゼタピル (imazethapyr) ]、

スルホンアミド系除草性化合物 [フルメトスラム (flumetsulam)、メトスラム (metosulam)、ジクロスラム (diclosulam)、フロラスラム (florasulam)、ペノキススラム (penoxsulam)、ピロキススラム (pyroxsulam) ]、

ピリミジニルオキシ安息香酸系除草性化合物 [ピリチオバックナトリウム (pyrit

10

20

30

40

50

hiobac - sodium)、ビスピリバックナトリウム (bispyribac - sodium)、ピリミノバックメチル (pyriminobac - methyl)、ピリベンゾキシム (pyribenzoxim)、ピリフタリド (pyrifthalid)、ピリミスルファン (pyrimisulfan) ]、

その他の系統の除草性化合物 [ ベンタゾン (bentazon)、プロマシル (bromacil)、ターバシル (terbacil)、クロルチアミド (chlorothiamid)、イソキサベン (isoxaben)、ジノセブ (dinoseb)、アミトロール (amitrole)、シンメチリン (cinmethylin)、トリジファン (tridiphane)、ダラポン (dalapon)、ジフルフェンゾピルナトリウム (diflufenzopyr - sodium)、ジチオピル (dithiopyr)、チアゾピル (thiazopyr)、フルカルバゾンナトリウム (flucarbazone - sodium)、プロポキシカルバゾンナトリウム (propoxycarbazone - sodium)、メフェナセット (mefenacet)、フルフェナセット (flufenacet)、フェントラザミド (fentrazaamide)、カフェンストロール (cafenstrole)、インダノファン (indanofan)、オキサジクロメホン (oxaziclomefone)、ベンフレセート (benfuresate)、ACN、ピリデート (pyridate)、クロリダゾン (chloridazon)、ノルフルラゾン (norflurazon)、フルルタモン (flurtamone)、ジフルフェニカン (diflufenican)、ピコリナフェン (picolinafen)、ベフルブタミド (beflubutamid)、クロマゾン (clomazone)、アミカルバゾン (amicarbazone)、ピラクロニル (pyraclonil)、ピロキサスルホン (pyroxasulfone)、チエンカルバゾンメチル (thiencarbazone - methyl) ]、

薬害軽減性化合物 [ フリラゾール (furilazole)、ジクロルミッド (dichlormid)、ベノキサコール (benoxacor)、アリドクロール (allidochlor)、イソキサジフェンエチル (isoxadifen - ethyl)、フェンクロリム (fencloirim)、シプロスルファミド (cyprosulfamide)、シオメトリニル (cyometrinil)、オキサベトリニル (oxabetrinil)、フルクソフェニム (fluxofenim)、フルラゾール (flurazole)、1,8-ナフタル酸無水物 (1,8-Naphthalic Anhydride) ]

#### 【0088】

##### 製剤例 8

本化合物 (I - b - 14) 5 部と、化合物 B 1 部と、前記の A 群から選ばれる化合物いずれか 1 種 10 部とを、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 20 部および珪藻土 58 部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して水和剤を得る。

#### 【0089】

##### 製剤例 9

本化合物 (I - b - 23) 10 部と、化合物 B 10 部と、前記の A 群から選ばれる化合物いずれか 1 種 10 部とを、ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート 3 部、CMC (カルボキシメチルセルロース) 3 部、水 64 部を混合してフロアブル剤を得る。

#### 【0090】

##### 製剤例 10

本化合物 (I - a - 19) 1 部と、化合物 B 10 部と、前記の A 群から選ばれる化合物いずれか 1 種 5 部とを、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 20 部および珪藻土 58 部を混合した中に加え、良く攪拌、混合して水和剤を得る。

#### 【0091】

以下、試験例を示す。

### 試験例 1 雑草への茎葉散布試験

直径 8 cm、深さ 6.5 cm のプラスチックカップに畑地土壌を充填し、これにイヌビエ (*Echinochloa crus-galli*) 及びアキノエノコログサ (*Setaria faberi*) の雑草種子をまき、約 0.5 cm の覆土をした後、温室内で所定の期間栽培した。雑草が 1 ~ 2 葉期まで生育した時、化合物 I - a - 1 及び化合物 B を含む薬剤希釈液を所定の処理薬量で雑草全体に均一に散布、供試した。なお薬剤希釈液は化合物 I - a - 1 と化合物 B との夫々所定量をトゥイーン 20 (ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、MP バイオメディカルズ・インク製) のジメチルホルムアミド溶液 (2%) に溶解し、脱イオン水で希釈することにより調製した。薬剤処理後の植物は温室内で栽培し、処理 20 日後に除草効果を表 6 の基準に従って評価した。

また、化合物 I - a - 1 を、I - a - 14、I - a - 19、I - b - 20 又は I - b - 23 に替えること以外は同様にして、その他の本発明除草用組成物についても散布供試した。結果を表 7 に示す。

【0092】

【表 6】

指数	除草効果
10	100% (完全枯死) の除草効果
9	90%以上100%未満の除草効果
8	80%以上90%未満の除草効果
7	70%以上80%未満の除草効果
6	60%以上70%未満の除草効果
5	50%以上60%未満の除草効果
4	40%以上50%未満の除草効果
3	30%以上40%未満の除草効果
2	20%以上30%未満の除草効果
1	10%以上20%未満の除草効果
0	0% (無作用) 以上10%未満の除草効果

【0093】

【表 7】

本発明除草用組成物	薬量 (g/ha)	除草効果	
		イヌビエ	アキノエノコログサ
I-a-1+化合物 B	500+500	10	9
I-a-14+化合物 B	500+500	10	10
I-a-19+化合物 B	500+500	9	9
I-b-20+化合物 B	500+500	9	9
I-b-23+化合物 B	500+500	10	10

【0094】

### 試験例 2 土壌への散布試験

直径 8 cm、深さ 6.5 cm のプラスチックカップに畑地土壌を充填し、これにイヌビエ (*Echinochloa crus-galli*) 及びアキノエノコログサ (*Setaria faberi*) の雑草種子をまき、約 0.5 cm の覆土をした。次いで、化合物 I - a - 15 及び化合物 B を含む薬剤希釈液を所定の処理薬量で土壌表面に均一に散布、供試した。なお薬剤希釈液は試験例 1 と同様の方法により調製した。薬剤処理後の植物は温室内で栽培し、処理 20 日後に除草効果を観察評価し、試験例 1 と同様に 0 ~ 10 の 11 段階で示した。

また、化合物 I - a - 15 を、I - a - 17、I - a - 21、I - b - 24 又は I - b - 35 に替えること以外は同様にして、その他の本発明除草用組成物についても散布供試

10

20

30

40

50

した。結果を表 8 に示す。

【 0 0 9 5 】

【 表 8 】

本発明除草用組成物	薬量 (g/ha)	除草効果	
		イヌビエ	アキノエノコログサ
I-a-15+化合物B	500+500	10	10
I-a-17+化合物B	500+500	10	10
I-a-21+化合物B	500+500	9	10
I-b-24+化合物B	500+500	10	10
I-b-35+化合物B	500+500	10	10

10

【 産業上の利用可能性 】

【 0 0 9 6 】

本発明除草用組成物の有効量を雑草又は雑草の生育する土壤に施用することにより、雑草を防除することができる。