

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第6869192号
(P6869192)

(45) 発行日 令和3年5月12日(2021.5.12)

(24) 登録日 令和3年4月15日(2021.4.15)

(51) Int.Cl.

F 1

C07D 207/277 (2006.01)
A01N 43/36 (2006.01)
A01P 13/00 (2006.01)

C07D 207/277
A01N 43/36
A01P 13/00

C S P
C

請求項の数 11 (全 95 頁)

(21) 出願番号 特願2017-561960 (P2017-561960)
 (86) (22) 出願日 平成28年5月19日 (2016.5.19)
 (65) 公表番号 特表2018-517700 (P2018-517700A)
 (43) 公表日 平成30年7月5日 (2018.7.5)
 (86) 國際出願番号 PCT/US2016/033231
 (87) 國際公開番号 WO2016/196019
 (87) 國際公開日 平成28年12月8日 (2016.12.8)
 審査請求日 令和1年5月13日 (2019.5.13)
 (31) 優先権主張番号 62/168,360
 (32) 優先日 平成27年5月29日 (2015.5.29)
 (33) 優先権主張国・地域又は機関
米国(US)

(73) 特許権者 391022452
エフ エム シー コーポレーション
FMC CORPORATION
アメリカ合衆国 19104 ペンシルベニア州 フィラデルフィア ウォールナットストリート2929
(74) 代理人 100127926
弁理士 結田 純次
(74) 代理人 100140132
弁理士 竹林 則幸
(72) 発明者 マシュー・ジェームズ・キャンベル
アメリカ合衆国メリーランド州21911
.ライジングサン, ジョセフビグスハイウェイ791

最終頁に続く

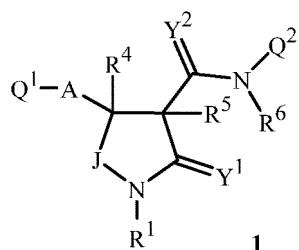
(54) 【発明の名称】除草剤としての置換環状アミド

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式1:

【化1】



10

[式中、

Aは、-CH₂-、-CH₂O-、-CH₂NH-、-OCH₂-、-NHCH₂-、-CH=CH-、-CC-、-NH-、-CH₂CH₂-もしくは-O-、ここで、式中、左側に突き出ている自由結合は、AからQ¹への接続点を指し、右側に突き出ている自由結合は、Aから式1の残りへの接続点を指す、であり；

Q¹は、R⁷から独立して選択される2個までの置換基で置換されたフェニル環であり；

Q²は、R¹⁰から独立して選択される3個までの置換基で置換されたフェニル環であ

20

り；

Y¹ および Y² は、どちらもO であり；

J は、 - C R² R³ - であり；

R¹ は、 H、 C₁ ~ C₆ アルキルもしくは C₁ ~ C₆ ハロアルキルであり；

R² および R³ は、それぞれ独立して Hもしくは C H₃ であり；

各 R⁴ は、独立して Hもしくは C H₃ であり；

各 R⁵ は、独立して Hもしくは C H₃ であり；

R⁶ は、 Hであり；

各 R⁷ は、独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ ~ C₈ アルキル、C₂ ~ C₈ シアノアルキル、C₁ ~ C₈ シアノアルコキシ、C₁ ~ C₈ ハロアルキル、C₂ ~ C₈ アルケニル、C₂ ~ C₈ ハロアルケニル、C₂ ~ C₈ アルキニル、C₂ ~ C₈ ハロアルキニル、C₁ ~ C₈ ニトロアルキル、C₂ ~ C₈ ニトロアルケニル、C₂ ~ C₈ アルコキシアルキル、C₃ ~ C₈ アルコキシアルコキシアルキル、C₂ ~ C₈ ハロアルコキシアルキル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₃ ~ C₈ ハロシクロアルキル、C₄ ~ C₁₀ シクロアルキルアルキル、C₄ ~ C₁₀ アルキルシクロルアルキル、C₁ ~ C₈ アルコキシ、C₁ ~ C₈ ハロアルコキシ、C₂ ~ C₈ アルケニルオキシ、C₂ ~ C₈ ハロアルケニルオキシ、C₃ ~ C₈ アルキニルオキシ、C₃ ~ C₈ ハロアルキニルオキシ、C₃ ~ C₈ シクロアルコキシ、C₁ ~ C₈ アルキルチオ、C₁ ~ C₈ ハロアルキルチオ、C₁ ~ C₈ アルキルスルフニル、C₁ ~ C₈ ハロアルキルスルフィニル、C₁ ~ C₈ アルキルスルホニル、C₁ ~ C₈ ハロアルキルスルホニル、ヒドロキシ、ホルミル、C₂ ~ C₈ アルキルカルボニル、C₂ ~ C₈ アルキルカルボニルオキシ、C₁ ~ C₈ アルキルスルホニルオキシ、C₁ ~ C₈ ハロアルキルスルホニルオキシ、アミノ、C₁ ~ C₄ アルキルアミノ、C₂ ~ C₄ ジアルキルアミノ、ホルミルアミノ、C₂ ~ C₄ アルキルカルボニルアミノ、- SF₅、- SCN、C₃ ~ C₁₂ トリアルキルシリル、トリメチルシリルメチルもしくはトリメチルシリルメトキシであり；そして、

各 R¹⁰ は、独立してハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、C₁ ~ C₈ アルキル、C₂ ~ C₈ シアノアルキル、C₁ ~ C₈ シアノアルコキシ、C₁ ~ C₈ ハロアルキル、C₂ ~ C₈ アルケニル、C₂ ~ C₈ ハロアルケニル、C₂ ~ C₈ アルキニル、C₂ ~ C₈ ハロアルキニル、C₁ ~ C₈ ニトロアルキル、C₂ ~ C₈ ニトロアルケニル、C₂ ~ C₈ アルコキシアルキル、C₃ ~ C₈ アルコキシアルコキシアルキル、C₂ ~ C₈ ハロアルコキシアルキルもしくは C₃ ~ C₈ シクロアルキルである；

ここで、

(a) A が - C H₂ - であり、Q² が 2 - トリフルオロメチルフェニルである場合は、Q¹ は 2 - トリフルオロメチルフェニル、4 - トリフルオロメチルフェニル、2, 3 - ジフルオロフェニル以外であり；そして、

(b) A が - C H₂ - であり、Q² が 2, 3 - ジフルオロフェニルである場合は、Q¹ は 3 - トリフルオロメチルフェニル以外である] から選択される化合物、それらの N - オキシドおよび塩。

【請求項 2】

A は、 - C H₂ - であり；

R¹ は、 H、メチルもしくはエチルであり；

R² は、 Hであり；

R³ は、 Hであり；

R⁴ は、 Hであり；

R⁵ は、 Hであり；

各 R⁷ は、独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ ~ C₈ アルキル、C₂ ~ C₈ シアノアルキル、C₁ ~ C₈ シアノアルコキシ、C₁ ~ C₈ ハロアルキル、C₂ ~ C₈ アルケニル、C₂ ~ C₈ ハロアルケニル、C₂ ~ C₈ アルキニル、C₂ ~ C₈ ハロアルキニル、C₁ ~ C₈ ニトロアルキル、C₂ ~ C₈ ニトロアルケニル、C₂ ~ C₈ アルコキシアルキル、C₃ ~ C₈ アルコキシアルコキシアルキル、C₂ ~ C₈ ハロアルコキシアルキル、C

10

20

30

40

50

$C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロルアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ アルキニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ ハロアルキニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニル、ヒドロキシ、ホルミル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニルオキシ、アミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、ホルミルアミノ、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニルアミノ、-SF₅、-S CN、 $C_3 \sim C_{12}$ トリアルキルシリル、トリメチルシリルメチルもしくはトリメチルシリルメトキシであり；および

R¹⁰ は、独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルもしくは $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

各R⁷ は、独立してハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルもしくは $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニルであり；および

各R¹⁰ は、独立してハロゲンもしくは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルである、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

Q¹ は、R⁷ から独立して選択される1個の置換基で置換されたフェニル環であり；

Q² は、R¹⁰ から選択された2個の置換基を有するフェニル環であり、前記置換基の一方はオルト位にあり、他方の前記置換基はメタ位もしくはパラ位にある、請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

Q² は、R¹⁰ から選択される3個の置換基で置換されたフェニル環であり、これら3個の置換基は、フェニル環のオルト位、メタ位およびパラ位にある、請求項3に記載の化合物。

【請求項6】

A は、-CH₂-、-CH=CH-、-C-C-もしくは-CH₂CH₂-であり；

R¹ は、Hであり；

各R⁷ は、独立してハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルもしくは $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルであり；および

各R¹⁰ は、独立してハロゲンもしくは $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

N-(2,3-ジフルオロフェニル)-4-[(4-フルオロフェニル)メチル]-2-オキソ-3-ピロリジンカルボキサミド；および

4-[(3-クロロフェニル)メチル]-N-(2,3-ジフルオロフェニル)-2-オキソ-3-ピロリジンカルボキサミドからなる群から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

請求項1～7のいずれか1項に記載の化合物ならびに界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1つの構成成分を含む除草剤組成物。

【請求項9】

請求項1～7のいずれか1項に記載の化合物、他の除草剤および除草剤毒性緩和剤からなる群から選択される少なくとも1つの追加の有効成分ならびに界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1つの構成成分を含む除草剤組成物。

【請求項10】

10

20

30

40

50

(a) 請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物、ならびに (b) (b 1) 光化学系 I I 阻害剤、(b 2) アセトヒドロキシ酸シンターゼ (A H A S) 阻害剤、(b 3) アセチル - C o A カルボキシラーゼ (A C C a s e) 阻害剤、(b 4) オーキシン模倣体、(b 5) 5 - エノール - ピルビルシキミ酸 - 3 - リン酸 (E P S P) シンターゼ阻害剤、(b 6) 光化学系 I 電子ダイバーター、(b 7) プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼ (P P O) 阻害剤、(b 8) グルタミンシンテターゼ (G S) 阻害剤、(b 9) 超長鎖脂肪酸 (V L C F A) エロンガーゼ阻害剤、(b 10) オーキシン輸送阻害剤、(b 11) フイトエンデサチュラーゼ (P D S) 阻害剤、(b 12) 4 - ヒドロキシフェニル - ピルビン酸ジオキシゲナーゼ (H P P D) 阻害剤、(b 13) ホモゲンチジン酸ソラネシルトランスフェラーゼ (solan es yl t r a n s f e r a s e) (H S T) 阻害剤、(b 14) セルロース生合成阻害剤、(b 15) 有糸分裂攪乱物質、有機ヒ素剤、アスマム、プロモブチド、シンメチリン、クミルロン、ダゾメット、ジフェンゾコート、ダイムロン、エトベンザニド、フルレノール、ホサミン、ホサミン - アンモニウム、ヒダントシン、メタム、メチルダイムロン、オレイン酸、オキサジクロメホン、ペラルゴン酸およびビリブチカルブを含む他の除草剤、(b 16) 除草剤毒性緩和剤および (b 1) ~ (b 16) の化合物の塩から選択される少なくとも 1 つの追加の有効成分を含む除草剤混合物。

【請求項 11】

望ましくない植生の成長を防除するための方法であって、前記植生もしくはその環境を除草剤性有効量の請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物と接触させる工程を含む方法。

10

20

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、望ましくない植生を防除するための所定の置換環状アミド、それらの N - オキシドおよび塩ならびに組成物およびそれらの使用方法に関する。

【背景技術】

【0002】

望ましくない植生の防除は、高い作物効率を達成する際に極めて重要である。雑草の成長の選択的防除を達成することは、特に、例えばイネ、ダイズ、サトウダイコン、トウモロコシ、ジャガイモ、コムギ、オオムギ、トマトおよびプランテーション作物などの有用な作物において極めて望ましい。そのような有用な作物における抑制されない雑草成長は、生産性の有意な低下を引き起こす可能性があり、それにより消費者にとってのコスト増大を生じさせる。非農耕地域における望ましくない植生の防除もまた重要である。これらの目的のためには多数の製品を市販で入手できるが、より効果的であり、より安価であり、毒性が低く、環境的に優しく、または異なる作用部位を有する新規な化合物に対する必要が依然としてある。

30

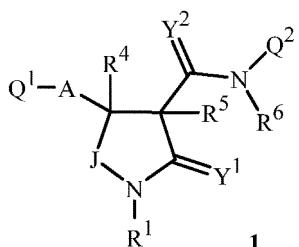
【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0003】

本発明は、式 1 (すべての立体異性体を含む) :

【化 1】



40

50

[式中、

Aは、3個までの炭素原子、1個までのO原子、1個までのS原子および2個までのN原子から選択される1～3個の原子を含有する飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和鎖であり、ここで2個までの炭素員は独立してC(=O)およびC(=S)から選択され、硫黄原子員はS(=O)_u(=NR⁸)_vから選択され；前記鎖は、炭素原子上のR^{1～5}および窒素原子上のR^{1～6}から独立して選択される5個までの置換基で任意選択的に置換されており；

Q¹は、各環もしくは環系が、R⁷から独立して選択される5個までの置換基で任意選択的に置換されたフェニル環もしくはナフタレニル環系；または、各環もしくは環系が、炭素原子ならびに2個までのO原子、2個までのS原子および4個までのN原子から独立して選択される1～4個のヘテロ原子から選択される環員を含有する5～6員の芳香族複素環または8～10員の芳香族複素環式二環系であり、ここで3個までの炭素環員はC(=O)およびC(=S)から独立して選択され、硫黄原子環員は、各環もしくは環系が、炭素原子環員上のR⁷から独立して選択され、および窒素原子環員上のR⁹から選択される5個までの置換基で任意選択的に置換されたS(=O)_u(=NR⁸)_vから独立して選択され；

Q²は、各環もしくは環系が、R^{1～0}から独立して選択される5個までの置換基で任意選択的に置換されたフェニル環もしくはナフタレニル環系；または、各環もしくは環系が、炭素原子ならびに2個までのO原子、2個までのS原子および4個までのN原子から独立して選択される1～4個のヘテロ原子から選択される環員を含有する5～6員の芳香族複素環または8～10員の芳香族複素環式二環系であり、ここで3個までの炭素環員はC(=O)およびC(=S)から独立して選択され、硫黄原子環員は、各環もしくは環系が、炭素原子環員上のR^{1～0}から独立して選択され、および窒素原子環員上のR^{1～1}から選択される5個までの置換基で任意選択的に置換されたS(=O)_u(=NR⁸)_vから独立して選択され；

Y¹およびY²は、それぞれ独立してO、SもしくはNR^{1～2}であり；

Jは、-CR²R³-；または-CR²R³-CR²aR³a-（式中、-CR²R³-部分は、Nに直接的に接続されている）であり；

R¹は、H、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、ホルミル、C₃～C₈アルキルカルボニルアルキル、-C(C₁～C₄アルキル)=N-O(C₁～C₄アルキル)、-C(O)NH₂、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₃～C₆アルキニル、C₂～C₆シアノアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₄～C₈シクロアルキルアルキル、C₂～C₈アルコキシアルキル、C₃～C₈アルコキシアルコキシアルキル、C₂～C₈ハロアルコキシアルキル、C₂～C₈ハロアルケニルアルキル、C₂～C₈アルキルチオアルキル、C₂～C₈アルキルスルフィニルアルキル、C₂～C₈アルキルスルホニルアルキル、C₂～C₈アルキルカルボニル、C₂～C₈ハロアルキルカルボニル、C₄～C₁₀シクロアルキルカルボニル、C₅～C₁₀シクロアルキルカルボニルアルキル、C₂～C₈アルコキシカルボニル、C₂～C₈ハロアルコキシカルボニル、C₄～C₁₀シクロアルコキシカルボニル、C₂～C₈アルキルアミノアルキル、C₂～C₈アルキルアミノカルボニル、C₃～C₁₀ジアルキルアミノカルボニル、C₄～C₁₀シクロアルキルアミノカルボニル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆ハロアルキルチオ、C₃～C₈シクロアルキルチオ、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₃～C₈シクロアルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、C₃～C₈シクロアルキルスルホニル、C₁～C₆アルキルアミノスルホニル、C₂～C₈ジアルキルアミノスルホニル、C₃～C₁₀トリアルキルシリル；もしくはそれが環員上でR^{1～3}から独立して選択される5個までの置換基で任意選択的に置換されているアリールカルボニル、アリールアルケニルアルキル、アリールカルボニルアルキルもしくは-CPh=N-O(C₁～C₄アルキル)；もしくはG¹であり；

R²およびR³は、それぞれ独立してH、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁～C₄アルキル

10

20

30

40

50

、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルもしくは $C_1 \sim C_4$ アルコキシであり；または

R^2 および R^3 は、それらが結合する炭素原子と一緒にされて $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル環を形成し；

R^{2a} および R^{3a} は、それぞれ独立してH、ハロゲンもしくは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；または

R^{2a} および R^{3a} は、それらが結合する炭素原子と一緒にされて $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル環を形成し；

各 R^4 は、独立してH、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシもしくは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

各 R^5 は、独立してH、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、シアノもしくは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^6 は、H、ヒドロキシ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニルもしくは $C_3 \sim C_{10}$ トリアルキルシリル；もしくは G^1 であり；

各 R^7 は、独立してハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_8$ シアノアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_8$ ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ニトロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロルアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ アルキニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ ハロアルキニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニル、ヒドロキシ、ホルミル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニルオキシ、アミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、ホルミルアミノ、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニルアミノ、-

-SF₅、-SCN、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフイニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロアルコキシアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシハロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_3 \sim$

10

20

30

40

50

C_8 ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニルオキシ、 $C_3 \sim C_{12}$ トリアルキルシリル、トリメチルシリルメチルもしくはトリメチルシリルメトキシ；もしくは G^2 であり；または $R^{17}ON = CR^{17a} -$ 、 $(R^{18})_2C = NO -$ 、 $(R^{19})_2NN = CR^{17a} -$ 、 $(R^{18})_2C = NNR^2$ $^{0a} -$ 、 $R^{20}N = CR^{17a} -$ 、 $(R^{18})_2C = N -$ 、 $R^{17}ON = CR^{17a}C(R^{23b})_2 -$ もしくは $(R^{18})_2C = NOC(R^{24a})_2 -$ (式中、右側に突き出ている自由結合は Q^1 との接続点を指す) であり；または

2つの隣接 R^7 は、それらが結合する炭素原子と一緒にされて $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル環を形成し；

各 R^{10} は、独立してハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_8$ シアノアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_8$ ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ニトロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロルアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニル、ヒドロキシ、ホルミル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニルオキシ、アミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_4$ ジアルキルアミノ、ホルミルアミノ、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニルアミノ、 $-SF_5$ 、 $-SCN$ 、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルコキシ、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロアルコキシアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニルオキシ、 $C_3 \sim C_{12}$ トリアルキルシリル、トリメチルシリルメチルもしくはトリメチルシリルメトキシ；もしくは G^2 であり；または $R^{17}ON = CR^{17a} -$ 、 $(R^{18})_2C = NO -$ 、 $(R^{19})_2NN = CR^{17a} -$ 、 $(R^{18})_2C = NNR^2$ $^{20a} -$ 、 $R^{20}N = CR^{17a} -$ 、 $(R^{18})_2C = N -$ 、 $R^{17}ON = CR^{17a}C(R^{23b})_2 -$ もしくは $(R^{18})_2C = NOC(R^{24a})_2 -$ (式中、右側に突き出ている自由結合は Q^2 との接続点を指す) であり；または

2つの隣接 R^{10} は、それらが結合する炭素原子と一緒にされて $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル環を形成し；

各 R^8 は、独立してH、シアノ、 $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニルもしくは $C_2 \sim C_3$ ハロアルキルカルボニルであり；

各 R^9 および R^{11} は、独立してシアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルケニル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_3$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_3$ アルキルアミノアルキルもしくは $C_3 \sim C_4$ ジアルキルアミノアルキルであり；

10

20

30

40

50

各 R^{1~2} は、独立して H、シアノ、C₁~C₄ アルキル、C₁~C₄ ハロアルキル、C₁~C₄ アルコキシ、C₁~C₄ ハロアルコキシ、-(C=O)CH₃ もしくは-(C=O)CF₃ であり；

各 G¹ は、独立してフェニル、フェニルメチル(すなわち、ベンジル)、ピリジニルメチル、フェニルカルボニル(すなわち、ベンゾイル)、フェノキシ、フェニルエチニル、フェニルスルホニル、フェニルカルボニルアルキル、2-、3- もしくは 4-ピリジニルオキシまたは、それぞれが環員上で R^{1~3} から独立して選択される 5 個までの置換基で任意選択的に置換された 5 もしくは 6 員の芳香族複素環であり；

各 G² は、独立してフェニル、フェニルメチル(すなわち、ベンジル)、ピリジニルメチル、フェニルカルボニル(すなわち、ベンゾイル)、フェニルカルボニルアルキル、フェノキシ、フェニルエチニル、フェニルスルホニル、2-、3- もしくは 4-ピリジニルオキシまたはそれぞれが環員上で R^{1~4} から独立して選択される 5 個までの置換基で任意選択的に置換された 5 もしくは 6 員の芳香族複素環であり；

各 R^{1~3} および R^{1~4} は、独立してハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、-CHO、-C(=O)OH、-C(=O)NH₂、-SO₂NH₂、C₁~C₆ アルキル、C₁~C₆ ハロアルキル、C₂~C₆ アルケニル、C₂~C₆ アルキニル、C₂~C₈ アルキルカルボニル、C₂~C₈ ハロアルキルカルボニル、C₂~C₈ アルコキシカルボニル、C₄~C₁₀ シクロアルコキシカルボニル、C₅~C₁₂ シクロアルキルアルコキシカルボニル、C₂~C₈ アルキルアミノカルボニル、C₃~C₁₀ ジアルキルアミノカルボニル、C₁~C₆ アルコキシカルボニル、C₁~C₆ ハロアルコキシカルボニル、C₂~C₈ アルキルカルボニルオキシ、C₁~C₆ アルキルチオ、C₁~C₆ ハロアルキルチオ、C₁~C₆ アルキルスルフィニル、C₁~C₆ ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₆ アルキルスルホニル、C₁~C₆ ハロアルキルスルホニル、C₁~C₆ アルキルアミノスルホニル、C₃~C₁₀ トリアルキルシリル、C₁~C₆ アルキルアミノ、C₂~C₈ ジアルキルアミノ、C₂~C₈ アルキルカルボニルアミノ、C₁~C₆ アルキルスルホニルアミノ、フェニル、ピリジニルもしくはチエニルであり；

各 R^{1~5} は、独立してハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C₁~C₄ アルキル、C₁~C₄ ハロアルキル、C₁~C₄ アルコキシ、C₁~C₄ ハロアルコキシ、C₂~C₄ アルコキシアルキル、C₂~C₄ アルキルカルボニル、C₂~C₄ アルコキシカルボニル、C₃~C₆ シクロアルキルもしくは C₄~C₈ シクロアルキルアルキルであり；または

2 つの隣接 R^{1~5} は、それらが結合する炭素原子と一緒にされて C₃~C₇ シクロアルキル環を形成し；

各 R^{1~6} は、独立してシアノ、C₁~C₄ アルキル、C₁~C₄ ハロアルキル、C₁~C₄ アルコキシ、C₂~C₄ アルキルカルボニル、C₂~C₄ アルコキシカルボニルもしくは C₃~C₆ シクロアルキルであり；

各 R^{1~7} は、独立して H、C₁~C₆ アルキル、C₃~C₈ シクロアルキル、C₄~C₈ シクロアルキルアルキル、C₁~C₆ ハロアルキル、C₂~C₆ アルケニル、C₃~C₆ アルキニル、C₂~C₈ アルコキシアルキル、C₂~C₈ ハロアルコキシアルキル、C₂~C₈ アルキルチオアルキル、C₂~C₈ アルキルスルフィニルアルキル、C₂~C₈ アルキルスルホニルアルキル、C₂~C₈ アルキルカルボニル、C₂~C₁₀ シクロアルキルカルボニル、C₂~C₈ アルコキシカルボニル、C₂~C₈ アルキルアミノカルボニル、C₃~C₁₀ ジアルキルアミノカルボニル、C₄~C₁₀ シクロアルキルアミノカルボニル、C₁~C₆ アルキルスルフィニル、C₁~C₆ ハロアルキルスルフィニル、C₃~C₈ シクロアルキルスルフィニル、C₁~C₆ アルキルスルホニル、C₁~C₆ ハロアルキルスルホニル、C₃~C₈ シクロアルキルスルホニルもしくは C₃~C₁₀ トリアルキルシリル；もしくは G¹ であり；

各 R^{1~7a} は、独立して H、C₁~C₆ アルキル、C₃~C₈ シクロアルキル、C₄~C₈ シクロアルキルアルキル、C₁~C₆ ハロアルキル、C₂~C₆ アルケニル、C₃~C₆

10

20

30

40

50

C_6 アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルチオもしくは $C_3 \sim C_{10}$ トリアルキルシリル；もしくは G^1 であり；

各 R^{1-8} は、独立して H、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルアミノカルボニル、 $C_3 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノカルボニル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ジアルキルアミノスルホニルもしくは $C_3 \sim C_{10}$ トリアルキルシリル；もしくは G^1 であり；

各 R^{1~9} は、独立して H、C₁~C₆ アルキル、C₃~C₈ シクロアルキル、C₄~C₈ シクロアルキルアルキル、C₁~C₆ ハロアルキル、C₂~C₆ アルケニル、C₃~C₆ アルキニル、C₂~C₈ アルコキシアルキル、C₂~C₈ ハロアルコキシアルキル、C₂~C₈ アルキルチオアルキル、C₂~C₈ アルキルスルフィニルアルキル、C₂~C₈ アルキルスルホニルアルキル、C₂~C₈ アルキルカルボニル、C₂~C₈ ハロアルキルカルボニル、C₄~C₁₀ シクロアルキルカルボニル、C₂~C₈ アルコキシカルボニル、C₂~C₈ ハロアルコキシカルボニル、C₄~C₁₀ シクロアルコキシカルボニル、C₂~C₈ アルキルアミノカルボニル、C₃~C₁₀ ジアルキルアミノカルボニル、C₄~C₁₀ シクロアルキルアミノカルボニル、C₁~C₆ アルコキシ、C₁~C₆ アルキルスルフィニル、C₁~C₆ ハロアルキルスルフィニル、C₃~C₈ シクロアルキルスルフィニル、C₁~C₆ アルキルスルホニル、C₁~C₆ ハロアルキルスルホニル、C₃~C₈ シクロアルキルスルホニル、C₁~C₆ アルキルアミノスルホニル、C₂~C₈ ジアルキルアミノスルホニルもしくは C₃~C₁₀ トリアルキルシリル；もしくは G¹ であり；

各 R² は、独立して H、ヒドロキシ、アミノ、C₁～C₆ アルキル、C₃～C₈ シクロアルキル、C₄～C₈ シクロアルキルアルキル、C₁～C₆ ハロアルキル、C₂～C₆ アルケニル、C₃～C₆ アルキニル、C₂～C₈ アルコキシアルキル、C₂～C₈ ハロアルコキシアルキル、C₂～C₈ アルキルチオアルキル、C₂～C₈ アルキルスルフィニルアルキル、C₂～C₈ アルキルスルホニルアルキル、C₂～C₈ アルキルカルボニル、C₂～C₈ ハロアルキルカルボニル、C₄～C₁₀ シクロアルキルカルボニル、C₂～C₈ アルコキシカルボニル、C₂～C₈ ハロアルコキシカルボニル、C₄～C₁₀ シクロアルコキシカルボニル、C₂～C₈ アルキルアミノカルボニル、C₃～C₁₀ ジアルキルアミノカルボニル、C₄～C₁₀ シクロアルキルアミノカルボニル、C₁～C₆ アルコキシ、C₁～C₆ アルキルスルフィニル、C₁～C₆ ハロアルキルスルフィニル、C₃～C₈ シクロアルキルスルフィニル、C₁～C₆ アルキルスルホニル、C₁～C₆ ハロアルキルスルホニル、C₃～C₈ シクロアルキルスルホニル、C₁～C₆ アルキルアミノスルホニル、C₂～C₈ ジアルキルアミノスルホニルもしくは C₃～C₁₀ トリアルキルシリル；もしくは G¹ であり：

各 R^{2-0^a} は、独立して H、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₄ ~ C₈ シクロアルキルアルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₃ ~ C₆ アルキニル、C₂ ~ C₆ アルコキシアルキル、C₂ ~ C₆ ハロアルコキシアルキル、

$C_2 \sim C_8$ アルキルチオアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルフィニルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルスルホニルアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシもしくは $C_3 \sim C_{10}$ トリアルキルシリル；もしくはG¹であり；

各R^{2 3 b}は、独立してH、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニルもしくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；

各R^{2 4 a}は、独立してH、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_4$ アルコキシカルボニルもしくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；および

各uおよびvは、uおよびvの合計が0、1もしくは2であることを前提に、S(=O)_u(=N R⁸)_vの各例では、独立して0、1もしくは2であるが；

ただし、AがSであり、Q¹が未置換フェニルである場合は、Q²は未置換フェニル以外であることを前提とする]の化合物、それらのN-オキシドおよび塩、それらを含有する農業用組成物および除草剤としてのそれらの使用に向けられる。

【0004】

より詳細には、本発明は、式1（すべての立体異性体を含む）の化合物、それらのN-オキシドまたは塩に関する。本発明はさらに、本発明の（すなわち、除草性有効量にある）化合物ならびに界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1つの構成成分を含む除草剤組成物に関する。本発明はさらに、望ましくない植生の成長を防除するための方法であって、植生もしくはその環境を除草性有効量の本発明の（例えば、本明細書に記載した組成物としての）化合物と接触させる工程を含む方法に関する。

【0005】

本発明はさらに、除草剤混合物であって、（a）式1から選択される化合物、それらのN-オキシドおよび塩、ならびに（b）下記に記載する（b1）～（b16）から選択される少なくとも1つの追加の有効成分；ならびに（b1）～（b16）から選択される化合物の塩を含む除草剤混合物もまた含む。

【発明を実施するための形態】

【0006】

本明細書で用いるところでは、用語「含む（comprises）」、「含む（comprising）」、「含む（includes）」、「含む（including）」、「有する（has）」、「有する（having）」、「含有する（contains）」、「含有する（containing）」、「で特徴付けられる（characterized by）」、またはそれらの任意の他の変形は、明確に示される任意の制限を受けて、非排他的な包含をカバーすることを意図する。例えば、要素のリストを含む組成物、混合物、工程、方法、製品または装置は、それらの要素に必ずしも限定されるものではなく、明示的に列挙されていない、またはそのような組成物、混合物、工程、方法、製品または装置に固有ではない他の要素を含むことができる。

【0007】

移行句「からなる（consisting of）」は、明記されないいかなる要素、工程または原料をも排除する。特許請求の範囲における場合、そのようなものは、それらと通常関係がある不純物を除いて列挙されるもの以外の材料の包含をクレームから締め出す。語句「からなる」が、前文の直後よりもむしろ、クレームの本体の条項に現れる場合、それは、当該条項に記述される要素のみを限定し；他の要素は、全体としてクレームから排除されない。

【0008】

移行句「本質的に～からなる」は、逐語的に開示されたものに加えて、材料、工程、特

10

20

30

40

50

徴、構成成分もしくは要素を含む組成物、方法または装置を定義するために使用されるが、ただし、これらの追加の材料、工程、特徴、構成成分もしくは要素が本発明の基本的および新規な特徴へ実質的に影響を及ぼさないことを前提とする。用語「から本質的になる」は、「含む (comprising)」と、「からなる (consisting of)」の中間領域を占める。

【0009】

出願人らが、発明またはその一部を、「含む (comprising)」などの開放端用語を使って定義している場合、(特に明記しない限り)この記載が、用語「から本質的になる」または「からなる」を用いてそのような発明をまた記載していると解釈されるべきであることが容易に理解されるはずである。

10

【0010】

さらに、明確にそれとは反対を述べられない限り、「または (or)」は、包括的な「または」を意味し、排他的な「または」を意味しない。例えば、条件 A または B は、以下のいずれか 1 つによって満たされる：A が真であり（または存在し）かつ B が偽である（または存在しない）、A が偽であり（または存在せず）かつ B が真である（または存在する）、ならびに A および B の両方ともが真である（または存在する）。

【0011】

また、本発明の要素または成分に先行する不定冠詞「a」および「an」は、要素または成分の場合（すなわち、出現）の数について非限定的であることを意図する。このため「a」または「an」は、1 つもしくは少なくとも 1 つを含むと読まれるべきであり、要素または成分の単数語形はまた、特に数が明らかに単数形であることを意図しない限り複数形を含む。

20

【0012】

本明細書で言及する、単独または用語の組み合わせのいずれかにおいて使用される用語「実生」は、種の胚から成長する若い植物を意味する。

【0013】

本明細書で言及するように、単独または例えば「広葉雑草」などの用語のいずれかにおいて使用される用語「広葉」は、2 枚の子葉を有する胚を特徴とする被子植物の群を記載するために使用される用語である双子葉植物 (dicot または dicotyledon) を意味する。

30

【0014】

上記の例挙では、単独または例えば「アルキルチオ」もしくは「ハロアルキル」などの複合語のいずれかにおいて使用される用語「アルキル」には、直鎖状もしくは分岐状アルキル、例えば、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、または異なるブチル、ペンチルもしくはヘキシル異性体が含まれる。「アルケニル」には、直鎖状もしくは分岐状アルケン、例えば、エテニル、1 - プロペニル、2 - プロペニルならびに種々のブテニル、ペンテニルおよびヘキセニル異性体が含まれる。「アルケニル」には、さらにポリエン、例えば 1 , 2 - プロパジエニルおよび 2 , 4 - ヘキサジエニルが含まれる。「アルキニル」には、エチニル、1 - プロピニル、2 - プロピニルならびに種々のブチニル、ペンチニルおよびヘキシニル異性体などの直鎖状もしくは分岐状アルキンが含まれる。用語「トリアリルシリル」は、ケイ素を介して結合した 3 つの 3 つのアルキル基を意味し、各アルキルは同一であっても異なっていてもよい。

40

【0015】

「アルコキシ」には、例えば、メトキシ、エトキシ、n - プロピルオキシ、イソプロピルオキシならびに種々のブトキシ、ペントキシおよびヘキシルオキシ異性体が含まれる。「アルコキシアルキル」は、アルキル上のアルコキシ置換を意味する。「アルコキシアルキル」の例としては、 CH_3OCH_2- 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ が挙げられる。「アルコキシアルコキシ」は、アルコキシ上のアルコキシ置換を意味する。「アルコキシアルコキシアルキル」は、アルコキシアルキル部分のアルコキシ部分上のアルコ

50

キシ置換を意味する。「アルコキシアルコキシアルキル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_3)\text{CHOCH}_2-$ および $(\text{CH}_3\text{O})_2\text{CHOCH}_2-$ が挙げられる。「アルケニルオキシ」には、直鎖状もしくは分岐状アルケニルオキシ部分が含まれる。「アルケニルオキシ」の例としては、 $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}-$ 、 $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}-$ および $\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ が挙げられる。「アルキニルオキシ」には、直鎖状もしくは分岐状アルキニルオキシ部分が含まれる。「アルキニルオキシ」の例としては、 $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}-$ 、 $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}-$ および $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ が挙げられる。¹⁰「アルキルチオ」には、分岐状もしくは直鎖状アルキルチオ部分、例えば、メチルチオ、エチルチオならびに種々のプロピルチオ、ブチルチオ、ペンチルチオおよびヘキシルチオ異性体が含まれる。「アルキルスルフィニル」には、アルキルスルフィニル基の両方のエナンチオマーが含まれる。「アルキルスルフィニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})-$ ならびに種々のブチルフルフィニル、ペンチルスルフィニルおよびヘキシルスルフィニル異性体が挙げられる。²⁰「アルキルスルホニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2-$ ならびに種々のブチルスルホニル、ペンチルスルホニルおよびヘキシルスルホニル異性体が挙げられる。「アルキルスルホニルアミノ」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2\text{NH}-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{NH}-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{NH}-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2\text{NH}-$ ならびに種々のブチルスルホニルアミノ、ペンチルスルホニルアミノおよびヘキシルスルホニルアミノ異性体が挙げられる。³⁰「アルキルアミノスルホニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{NHS}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NH}\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHS}(\text{O})_2-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHS}(\text{O})_2-$ ならびに種々のブチルスルホニルアミノ、ペンチルスルホニルアミノおよびヘキシルスルホニルアミノ異性体が挙げられる。⁴⁰「アルキルスルホニルオキシ」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{O}-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2\text{O}-$ ならびに種々のブチルスルホニルオキシ、ペンチルスルホニルオキシおよびヘキシルスルホニルオキシ異性体が挙げられる。「アルキルチオアルキル」は、アルキル上のアルキルチオ置換を意味する。「アルキルチオアルキル」の例としては、 CH_3SCH_2- 、 $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2-$ が挙げられる。⁵⁰「シアノアルキル」は、1つのシアノ基で置換されたアルキル基を意味する。「シアノアルキル」の例としては、 NCCH_2- 、 $\text{NCCCH}_2\text{CH}_2-$ および $\text{CH}_3\text{CH}(\text{CN})\text{CH}_2-$ が挙げられる。「シアノアルコキシ」は、1つのシアノ基で置換されたアルコキシ基を意味する。「シアノアルコキシ」の例としては、 $\text{NCCCH}_2\text{O}-$ 、 $\text{NCCCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ および $\text{CH}_3\text{CH}(\text{CN})\text{CH}_2\text{O}-$ が挙げられる。「ニトロアルケニル」は、1つのニトロ基で置換されたアルケニル基を意味する。「ニトロアルケニル」の例としては、 $\text{O}_2\text{NCH}=\text{CH}-$ 、 $\text{O}_2\text{NCH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ および $\text{CH}_2=\text{CH}(\text{NO}_2)\text{CH}_2-$ が挙げられる。「ニトロアルキル」は、1つのニトロ基で置換されたアルキル基を意味する。「ニトロアルキル」の例としては、 O_2NCH_2- 、 $\text{O}_2\text{NCH}_2\text{CH}_2-$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}(\text{NO}_2)-$ が挙げられる。「アルキルスルフィニルアルキル」は、アルキル上のアルキルスルフィニル置換を意味する。「アルキルスルフィニルアルキル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2-$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$ が挙げられる。「アルキルスルホニルアルキル」は、アルキル上のアルキルスルホニル置換を意味する。「アルキルスルホニルアルキル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2-$ および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ が挙げられる。「シクロアルキルチオ」は、硫黄を介して結合したシクロアルキル基を意味する。「シクロアルキルチオ」の例としては、 $\text{c-P}_{\text{r}}-\text{S}$ 、 $\text{c-B}_{\text{u}}\text{S}$ および c-HexS -が挙げられる。「シクロアルキルスルフィニル」および「シクロ

アルキルスルホニル」は、同様に定義されており、「アルキルアミノ」、「ジアルキルアミノ」などは上記の例に類似して定義されている。「アルキルアミノアルキル」の例としては、 CH_3NHCH_2 - 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHCH}_2$ - および $\text{CH}_3\text{NHC}(\text{CH}_3)$ - が挙げられる。「アルキルアミノカルボニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{NHC(O)}$ - 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHCO}$ - および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC(O)}$ - が挙げられる。「ジアルキルアミノアルキル」の例としては、 $(\text{CH}_3)_2\text{NCH}_2$ - 、 $(\text{CH}_3)_2\text{NC(CH}_3)\text{H}$ - および $(\text{CH}_3)_2\text{NCH}_2$ - が挙げられる。「アルキルアミノカルボニル」の例としては、 $\text{CH}_3\text{NC(O)}$ - および $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NC(O)}$ - が挙げられる。「ジアルキルアミノカルボニル」の例としては、 $(\text{CH}_3)_2\text{NC(O)}$ - が挙げられる。「ジアルキルアミノスルホニル」の例としては、 $(\text{CH}_3)_2\text{NS(O)}$ - が挙げられる。10

【0016】

「シクロアルキル」には、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシリが含まれる。用語「アルキルシクロアルキル」は、シクロアルキル部分上のアルキル置換を意味し、例えば、エチルシクロプロピル、i - プロピルシクロブチル、3 - メチルシクロペンチルおよび4 - メチルシクロヘキシリを含む。用語「シクロアルキルアルキル」は、アルキル部分上のシクロアルキル置換を意味する。「シクロアルキルアルキル」の例としては、シクロプロピルメチル、シクロペンチルエチルおよび直鎖状もしくは分岐状アルキル基に結合した他のシクロアルキル部分が挙げられる。用語「シクロアルコキシ」は、例えばシクロペンチルオキシおよびシクロヘキシリオキシなどの酸素原子を介して連結したシクロアルキルを意味する。「シクロアルキルアルコキシカルボニル」は、アルコキシカルボニル部分上のシクロアルキル置換を意味する。「シクロアルキルアルコキシカルボニル」の例としては、c - Pr $\text{CH}_2\text{OC(=O)}$ - 、c - Bu $\text{CH}_2\text{OC(=O)}$ - およびc - Hex $\text{CH}_2\text{OC(=O)}$ - が挙げられる。「シクロアルコキシカルボニル」は、カルボニル部分上のシクロアルコキシ置換を意味する。「シクロアルコキシカルボニル」の例としては、シクロプロポキシカルボニル、シクロペントキシカルボニルおよび直鎖状もしくは分岐状アルキル基に結合した他のシ部分が挙げられる。「シクロアルキルアルコキシ」は、アルキル鎖に結合した酸素原子を介して連結したシクロアルキルアルキルを意味する。「シクロアルキルアルコキシ」の例としては、シクロプロピルメトキシ、シクロペンチルエトキシおよび直鎖状もしくは分岐状アルコキシ基に結合した他のシクロアルキル部分が挙げられる。20

【0017】

用語「ハロゲン」には、単独でか、もしくは「ハロアルキル」などの複合語でかのどちらかで、または「ハロゲンで置換されたアルキル」などの記載で用いられる場合、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素が含まれる。さらに、「ハロアルキル」などの複合語で用いられるときに、または「ハロゲンで置換されたアルキル」などの記載で用いられる場合、前記アルキルは、同じもしくは異なるものであってもよいハロゲン原子で部分もしくは完全置換されていてもよい。「ハロアルキル」または「ハロゲンで置換されたアルキル」の例としては、 F_3C - 、 ClCH_2 - 、 CF_3CH_2 - および CF_3CCl_2 - が挙げられる。用語「ハロシクロアルキル」、「ハロアルコキシ」、「ハロアルコキシアルキル」、「ハロアルキルチオ」、「ハロアルキルスルフィニル」、「ハロアルキルスルホニル」、「ハロアルキルスルホニルオキシ」、「ハロアルケニル」、「ハロアルケニルアルキル」、「ハロアルキニル」、「ハロアルケニルオキシ」、「ハロアルコキシカルボニル」、「ハロアルキルカルボニルオキシ」などは、用語「ハロアルキル」に類似して定義されている。「ハロアルコキシ」の例としては、 CF_3O - 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$ - 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{O}$ - および $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ - が挙げられる。「ハロアルコキシアルキル」の例としては、 CCl_3OCH_2 - 、 $\text{CF}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ - および $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ - が挙げられる。「ハロアルキルチオ」の例としては、 CCl_3S - 、 CF_3S - 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}$ - および $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}$ - が挙げられる。「ハロアルキルスルフィニル」の例としては、 $\text{CF}_3\text{S(O)}$ - 、 $\text{CCl}_3\text{S(O)}$ - 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S(O)}$ - 4050

O) - および $C F_3 C F_2 S(O) -$ が挙げられる。「ハロアルキルスルホニル」の例としては、 $C F_3 S(O)_2 -$ 、 $C C l_3 S(O)_2 -$ 、 $C F_3 C H_2 S(O)_2 -$ および $C F_3 C F_2 S(O)_2 -$ が挙げられる。「ハロアルキルスルホニルオキシ」の例としては、 $C F_3 S(O)_2 O -$ 、 $C C l_3 S(O)_2 O -$ 、 $C F_3 C H_2 S(O)_2 O -$ および $C F_3 C F_2 S(O)_2 O -$ が挙げられる。「ハロアルケニルアルキル」の例としては、 $(C l)_2 C = C H C H_2 -$ および $C F_3 C H_2 C H = C H C H_2 -$ が挙げられる。「ハロアルキニル」の例としては、 $H C C C H C l -$ 、 $C F_3 C C -$ 、 $C C l_3 C C -$ および $F C H_2 C C C H_2 -$ が挙げられる。「ハロアルコキシアルコキシ」の例としては、 $C F_3 O C H_2 O -$ 、 $C l C H_2 C H_2 O C H_2 C H_2 O -$ 、 $C l_3 C C H_2 O C H_2 O -$ ならびに分岐状アルキル誘導体が挙げられる。「ハロアルケニルオキシ」の例としては、 $C F_3 C H = C H O -$ 、 $C l C H_2 C H = C H C H_2 O -$ 、 $C H_3 C C l = C l C H_2 O -$ ならびに分岐状誘導体が挙げられる。「ハロアルコキシカルボニル」の例としては、 $C F_3 C H_2 O C (=O) -$ 、 $C l C H_2 C H_2 O C (=O) -$ および $C H_3 C C l_2 C H_2 O C (=O) -$ が挙げられる。「ハロアルキルカルボニルオキシ」の例としては、 $C F_3 C H_2 C (=O) O -$ 、 $C l C H_2 C H_2 C (=O) O -$ および $C H_3 C C l_2 C H_2 C (=O) O -$ が挙げられる。
10

【0018】

「アルキルカルボニル」は、 $C (=O)$ 部分に結合した直鎖状もしくは分岐状アルキル部分を意味する。「アルキルカルボニル」の例としては、 $C H_3 C (=O) -$ 、 $C H_3 C H_2 C H_2 (=O) -$ および $(C H_3)_2 C H C (=O) -$ が挙げられる。「アルキルカルボニルアルキル」の例としては、 $C H_3 C (=O) C H_2 -$ 、 $C H_3 C H_2 C H_2 C (=O) C H_2 -$ および $(C H_3)_2 C H C (=O) C H_2 -$ が挙げられる。「アルコキシカルボニル」の例としては、 $C H_3 O C (=O) -$ 、 $C H_3 C H_2 O C (=O) -$ 、 $C H_3 C H_2 C H_2 O C (=O) -$ 、 $(C H_3)_2 C H O C (=O) -$ ならびに種々のブトキシカルボニルもしくはペントキシカルボニル異性体が挙げられる。「アルキルカルボニルオキシ」は、カルボニルに結合した酸素原子を介して連結したアルキルカルボニル部分を意味する。「アルキルカルボニルオキシ」の例としては、 $C H_3 C (=O) O -$ 、 $C H_3 C H_2 C H_2 C (=O) O -$ および $(C H_3)_2 C H C (=O) O -$ が挙げられる。「アルキルカルボニルアミノ」は、カルボニルに結合したアミノ部分原子を介して連結したアルキルカルボニル部分を意味する。「アルキルカルボニルアミノ」の例としては、 $C H_3 C (=O) N H -$ 、 $C H_3 C H_2 C H_2 (=O) N H -$ および $(C H_3)_2 C H C (=O) N H -$ が挙げられる。「シクロアルキルアミノカルボニル」は、アミノカルボニル部分上のシクロアルキル置換を意味する。「シクロアルキルアミノカルボニル」の例としては、 $c - P r N H C (=O) -$ 、 $c - B u N H C (=O) -$ および $c - H e x N H C (=O) -$ が挙げられる。「シクロアルキルカルボニル」は、カルボニル部分上のシクロアルキル置換を意味する。「シクロアルキルカルボニル」の例としては、 $c - P r C (=O) -$ 、 $c - B u C H_2 N H C (=O) -$ および $c - H e x C H_2 N H C (=O) -$ シクロアルキルカルボニルが挙げられる。「シクロアルキルカルボニルアルキル」は、カルボニルアルキル部分上のシクロアルキル置換を意味する。「シクロアルキルカルボニルアルキル」の例としては、 $c - P r (=O) C H_2 -$ 、 $c - B u (=O) C H_2 C H_2 -$ および $c - H e x C (=O) C H_2 -$ が挙げられる。
20
30
40

【0019】

置換基内の炭素原子の総数は、「 $C_i \sim C_j$ 」接頭辞（ここで、 i および j は 1 ~ 12 の数である）によって示される。例えば、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルは、メチルスルホニルからブチルスルホニルを指定する； C_2 アルコキシアルキルは、 $C H_3 O C H_2 -$ を指定する； C_3 アルコキシアルキルは、例えば、 $C H_3 C H(O C H_3) -$ 、 $C H_3 C H_2 C H_2 -$ もしくは $C H_3 C H_2 O C H_2 -$ を指定する；および C_4 アルコキシアルキルは、例えば、 $C H_3 C H_2 C H_2 O C H_2 -$ および $C H_3 C H_2 O C H_2 C H_2 -$ を含む、計 4 個の炭素原子を含有するアルコキシ基で置換されたアルキル基の様々な異性体を指定する。
50

【0020】

化合物が前記置換基の数が1を超える可能性があることを示す下付き文字を有する置換基で置換される場合、前記置換基（それらが1を超える場合）は、規定された置換基の群、例えば $[(R^{1\sim 0})_n]$ （式中、nは、1、2、3、4もしくは5である）から独立して選択される。さらに、下付き文字がある範囲、例えば $(R)_{i\sim j}$ を指す場合、置換基の数は、i～jの間の包含的な整数から選択することができる。1つの基が水素であってよい置換基、例えば $(R^1$ もしくは $R^6)$ を含有するである場合、さらにこの置換基が水素と見なされる場合、これは未置換である前記基と同等であると認識される。1つの可変基が1つの位置、例えば $[(R^{1\sim 0})_n]$ （式中、nは0であってよい）に任意選択的に結合していると示される場合、水素は、たとえ可変基の定義において言及されていない場合でさえ、その位置に存在する場合がある。基上の1つ以上の複数の位置が「置換されていない」もしくは「非置換」と言われる場合は、水素原子は、任意の自由原子価を占めるために結合する。

【0021】

原子の環に関連した「完全飽和」との表現は、その環の原子間の結合がすべて単結合であることを意味する。環に関連した「完全不飽和」との表現は、その環内の原子間の結合が原子価結合理論にしたがって単結合もしくは二重結合であること、さらにその環内の原子間の結合が累積的である二重結合を伴わずに（すなわち、C=C=C、N=C=Cなどではない）できる限り多数の二重結合を含むことを意味する。環に関連した用語「部分不飽和」は、二重結合を介して隣接環員に結合した、および概念的潜在的に、存在する二重結合（すなわち、その部分不飽和形にある）の数より多数の隣接環員を介して非累積二重結合を収容する（すなわち、その十分に不飽和の対応物形にある）少なくとも1つの環員を含むことを意味する。完全不飽和の環がヒュッケル則を満たす場合、その環は芳香族であると記載することもできる。

【0022】

他に特に規定しない限り、式1の構成成分としての「環」もしくは「環系」（例えば、置換基Q¹）は、炭素環式もしくは複素環式である。用語「環系」は、2つ以上の縮合環を意味する。用語「二環式環系」は、他に規定しない限りどちらかの環が飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和であってよい2つの縮合環からなる環系を意味する。用語「環員」は、環もしくは環系の骨格を形成する原子もしくは他の部分（例えば、C(=O)、C=S）、S(O)もしくはS(O)₂）を指す。

【0023】

用語「炭素環」もしくは「炭素環系」は、環の骨格を形成する原子が炭素だけから選択される環もしくは環系を意味する。他に規定しない限り、炭素環は、飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和の環であってよい。完全不飽和炭素環がヒュッケル則を満たす場合、前記環は、「芳香族環」とも呼ばれる。「飽和炭素環式」は、相互に単結合によって連結した炭素原子からなる骨格を有する環を指し；他に規定しない限り、残りの炭素原子価は、水素原子に占められる。

【0024】

用語「複素環（heterocyclic ring）」、「複素環（heterocycle）」または「複素環式環系」は、環骨格を形成する少なくとも1つの原子が、炭素ではない、例えば、窒素、酸素または硫黄である環もしくは環系を意味する。典型的には、複素環は、4個以下の窒素、2個以下の酸素および2個以下の硫黄を含有する。他に規定しない限り、複素環式環は、飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和の環であってよい。完全不飽和複素環がヒュッケル則を満たす場合、前記環は、「芳香族複素環」とも呼ばれる。用語「芳香族複素環式二環系」は、環系の少なくとも1個の環原子が芳香族である複素環式環系を意味する。他に明記しない限り、複素環式環および複素環式環系は、前記炭素もしくは窒素上の水素の置換によって任意の利用可能な炭素もしくは窒素を介して結合することができる。

【0025】

10

20

30

40

50

「芳香族」は、環原子のそれぞれが本質的に同一平面にあってその環平面に垂直なp軌道を有すること、および(4n+2)電子(式中、nは正の整数である)がその環と結び付いてヒュッケル則に適合することを意味する。用語「芳香族環系」は、環系の少なくとも1つの環が芳香族である炭素環系または複素環式環系を意味する。

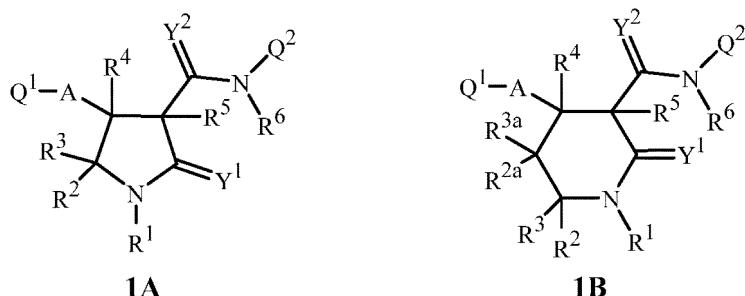
【0026】

複素環に関連して用語「任意選択的に置換された」は、非置換であるか、または非置換類似体が有する生物活性を消滅させない少なくとも1つの非水素置換基を有する基を言う。本明細書で用いるところでは、以下の定義が、特に明記しない限り適用されるものとする。用語「任意選択的に置換された」は、語句「置換されたもしくは非置換の」と、または用語「(非)置換の」と同じ意味で用いられる。特に明記しない限り、任意選択的に置換された基は、基の各置換可能な位置に置換基を有してもよく、各置換基は、互いに独立している。10

【0027】

発明の概要において記載したように、Jは、-CR²R³-; または-CR²R³-CR^{2a}R^{3a}- (式中、-CR²R³-部分は、Nに直接的に接続されている)のいずれであってもよい。例えば、Jが-CR²R³-である場合、式1の化合物は、式1Aによって表される。Jが-CR²R³-CR^{2a}R^{3a}-である場合、式1の化合物は、式1Bによって表される。20

【化2】



ここで、残りの変量のそれぞれは、発明の概要に定義されている。30

【0028】

発明の概要に記載したように、Aは、3個までの炭素原子、1個までのO原子、1個までのS原子および2個までのN原子から選択される1~3個の原子を含有する飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和鎖であり、ここで2個までの炭素員は独立してC(=O)およびC(=S)から選択され、硫黄原子員はS(=O)_u(=NR⁸)_vから選択され；前記鎖は、炭素原子上のR^{1~5}および窒素原子上のR^{1~6}から独立して選択される5個までの置換基で任意選択的に置換されている。Aの例としては、-ON=C(H)-、-ON=C(CH₃)-、-NHN=CH-、-NHN=C(CH₃)-、-N=CH-、-N=C(CH₃)-、-CH=N(O)-、-C(CH₃)=NO-、-CH=NNH-、-C(C(H)₃)=NNH-、-CH=N-、-C(CH₃)=N-、-CH₂CH₂CH₂-、-CH₂CH₂-、-CH₂-、-CF₂-、-C(=O)-、-CH=CH-、-CH=CHCH₂-、-CH₂CH=CH-、-C(C)-、-C(C)=CH₂-、-CH₂CH=C(H)-、-C(C)=C(C)-、-CH₂CH₂O-、-CH₂O-、-O-、-OCH₂CH₂-、-OCH₂-、-CH₂CH₂S-、-CH₂S-、-S-、-SO-、-SO₂-、-SCH₂CH₂-、-SCH₂-、-NHCH₂CH₂-、-CH₂NH-、-NH-、-NHCH₂-および-NHC(H)CH₂- (式中、左側に突き出ている結合はQ¹部分に接続しており、右側に突き出ている結合は式1の残りに接続されている)が挙げられる。40

【0029】

上記のように、Q¹およびQ²は、発明の概要において定義した置換基の群から選択さ50

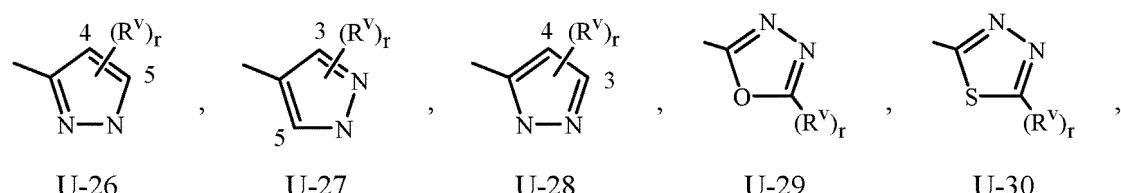
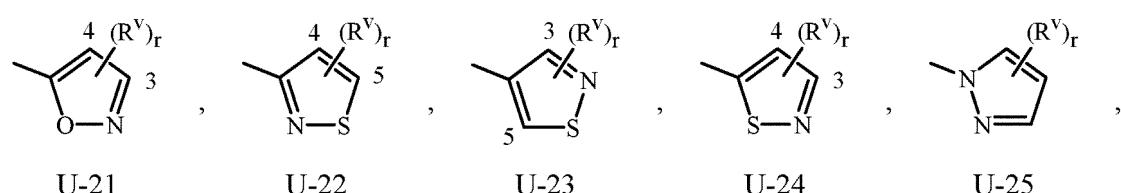
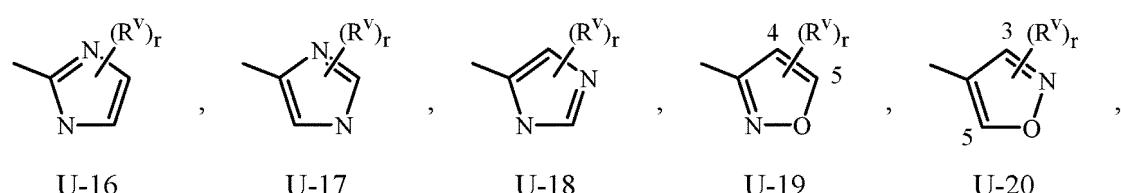
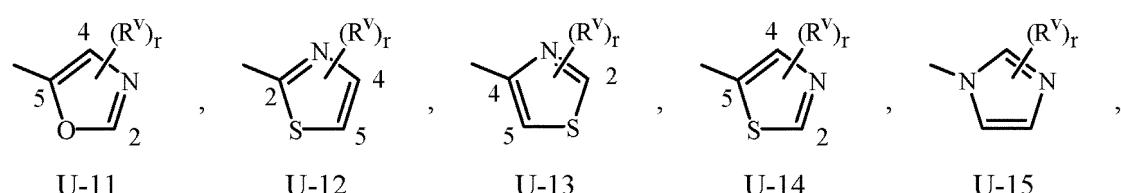
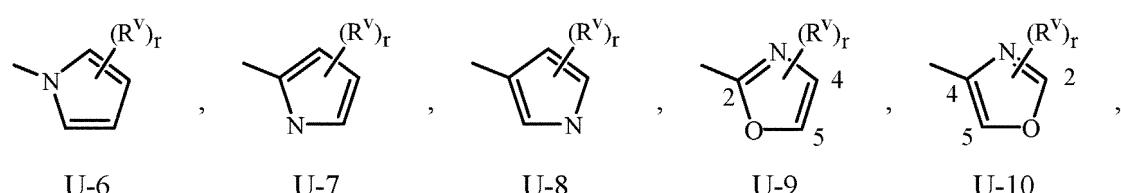
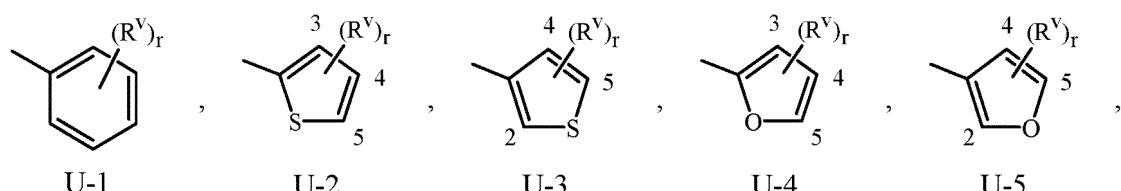
れる 1 つ以上の基で任意選択的に置換された（特に）フェニルであってよい。1 ~ 5 個の置換基で任意選択的に置換されたフェニルの例は、明細表 1 に U - 1 として例示された環（式中、例えば、R ^v は、発明の概要において Q ¹ について定義された R ⁷ であり、r は、整数（0 ~ 5）である；または R ^v は、発明の概要において Q ² について定義された R ^{1~0} であり；r は、整数（0 ~ 5）である；または R ^v は、発明の概要において Q ¹ について定義された R ⁹ であり、r は、整数（0 ~ 5）である（このとき、R ^v は、窒素原子に結合している；または R ^v は本発明の概要において Q ² について定義された R ^{1~1} であり、r は、整数（0 ~ 5）である（このとき、R ^v は、窒素原子に結合している））。発明の概要では、R ¹ は、それぞれが環員上で R ^{1~3} から独立して選択される 5 個までの置換基で任意選択的に置換されているアリールカルボニル、アリールアルケニルアルキル、アリールカルボニルアルキルもしくは - C Ph = N - O (C ₁ ~ C ₄ アルキル) であってよい。この状況では、用語「アリール」は R ^{1~3} によって置換されていてよく、上記に定義したカルボニル基、アルケニルアルキル基もしくはカルボニルアルキル基（例えば、アリール（C = O）-、アリール（C ₂ ~ C ₈ アルケニルアルキル）- もしくはアリール（C = O）（C ₁ ~ C ₄ アルキル）-）を介して式 1 の残りに接続されている。- C Ph = N - O (C ₁ ~ C ₄ アルキル) 部分内のフェニル基は、さらに R ^{1~3} で置換されてもよい。
。

【 0 0 3 0 】

上記のように、Q ¹ および Q ² は、（特に）発明の概要において定義したように 1 群の置換基から選択される 1 つ以上の置換基で任意選択的に置換された 5 もしくは 6 員の芳香族複素環であってよい。1 つ以上の置換基で任意選択的に置換された 5 もしくは 6 員の芳香族複素環の例としては、明細表 1 の環 U - 2 ~ U - 6 1 が挙げられ、ここで R ^v は、発明の概要において Q ¹ および Q ² について規定したように任意の置換基であり、および r は、各 U 基上の利用可能な位置の数によって限定される 0 ~ 4 の整数である。U - 2 9、U - 3 0、U - 3 6、U - 3 7、U - 3 8、U - 3 9、U - 4 0、U - 4 1、U - 4 2 および U - 4 3 は、たった 1 つの利用可能な位置しか有していないので、これらの U 基について、r は、整数 0 または 1 に限定され、r が 0 であることは、U 基が非置換であり、そして水素原子が、(R ^v)_r で示される位置に存在することを意味する。
。

【化3】

明細表1



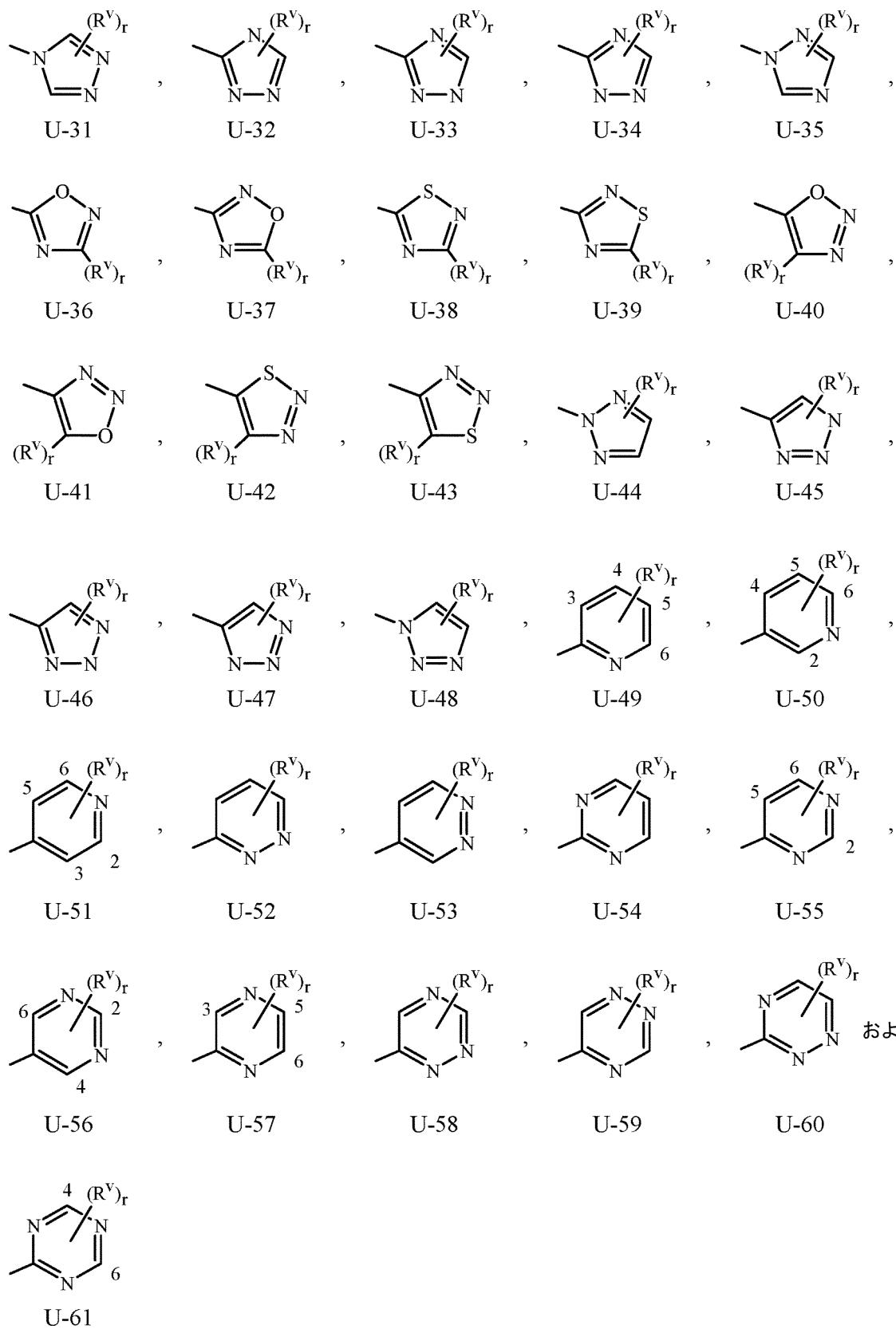
10

20

30

40

【化4】



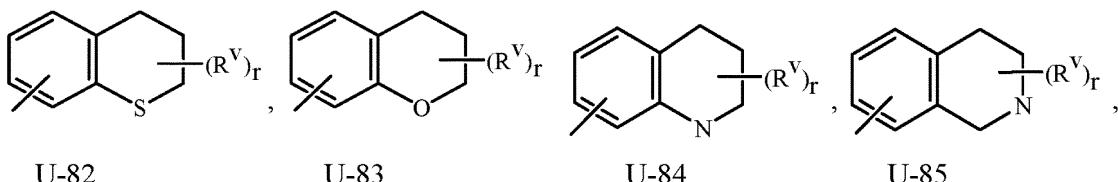
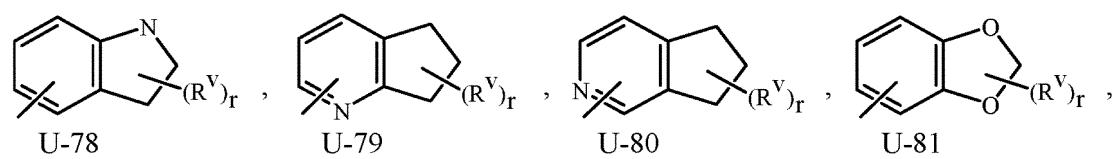
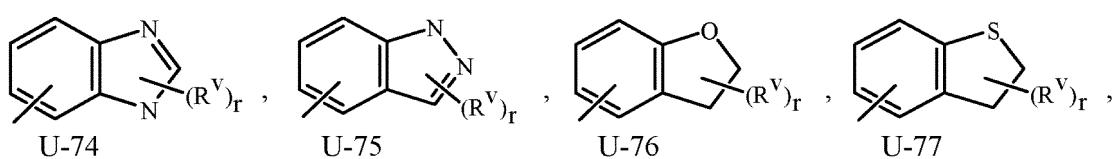
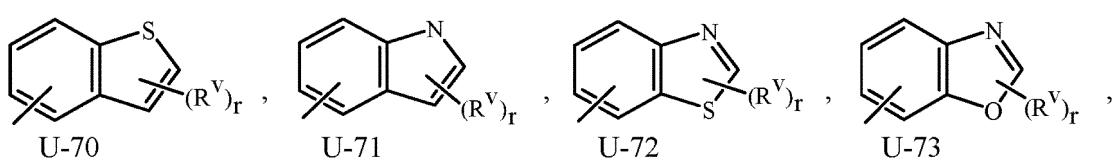
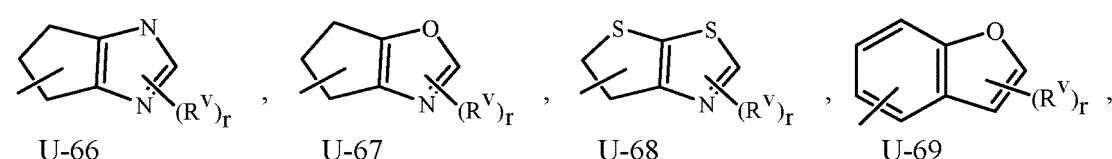
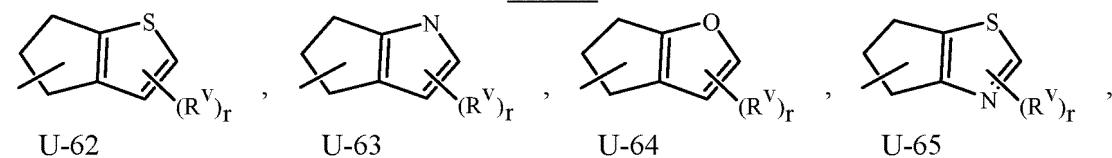
【0031】

上記のように、Q¹ および Q² は、(特に) 発明の概要において定義したように 1 群の置換基(すなわち、R⁷ および R^{1~0})から選択される 1 つ以上の置換基で任意選択的に置換された 8 ~ 10 員の芳香族複素環式二環系であってよい。1 つ以上の置換基で任意選択的に置換された 8 ~ 10 員の芳香族複素環式二環系の例としては、明細表 2 に例示した

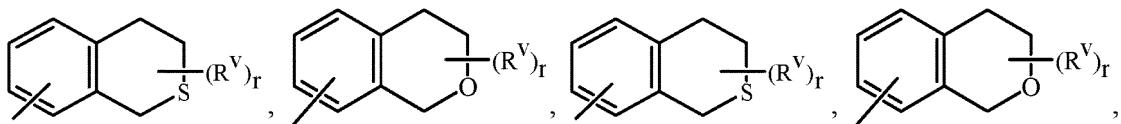
環 U - 62 ~ U - 100 が含まれ、ここで R^V は、発明の概要において Q¹ もしくは Q² について規定したように任意の置換基であり、および r は、典型的には 0 ~ 5 の整数である。

【化 5】

明細表2



【化6】

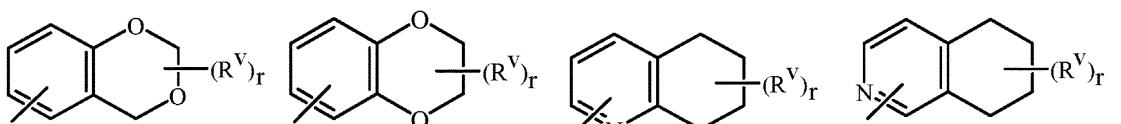


U-86

U-87

U-88

U-89



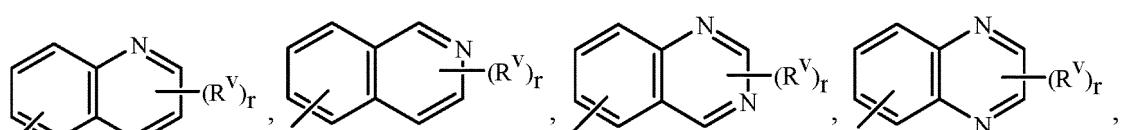
U-90

U-91

U-92

U-93

10



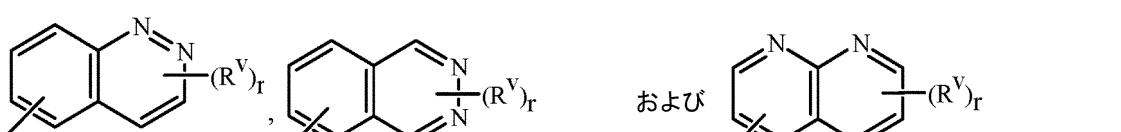
U-94

U-95

U-96

U-97

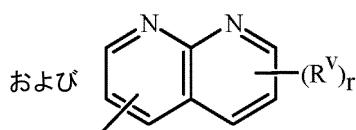
20



U-98

U-99

U-100



【0032】

R^v基は、構造U-1～U-100で示されているが、それらは任意選択の置換基であるので、存在することが必要ではないことに留意されたい。ここで留意すべきは、R^vがある原子に結合しているときにHである場合、これは、前記原子が非置換である場合と同じものであることである。それらの原子価を満たすために置換基を要する窒素原子は、HまたはR^vで置換されている。ここで留意すべきは、(R^v)_rとU基との接続点が浮いて示されている場合、(R^v)_rは、U基の任意の利用可能な炭素原子または窒素原子に結合できることである。ここで留意すべきは、U基上の接続点が浮いて示されている場合、U基は、水素原子の置換によりU基の任意の利用可能な炭素または窒素によって式1の残りに結合できることである。一部のU基は4個未満のR^v基（例えば、U-2～U-5、U-7～U-48およびU-52～U-61）としか置換させられないことに留意されたい。

30

【0033】

当技術分野においては、芳香族および非芳香族複素環式環および環系の調製を可能にするために多種多様な合成方法が公知であり；広範な概説については、全8巻のComprehensive Heterocyclic Chemistry, A.R.Katritzky and C.W.Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984および全12巻のComprehensive Heterocyclic Chemistry II, A.R.Katritzky, C.W.Rees and E.F.V.Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996を参照されたい。

40

【0034】

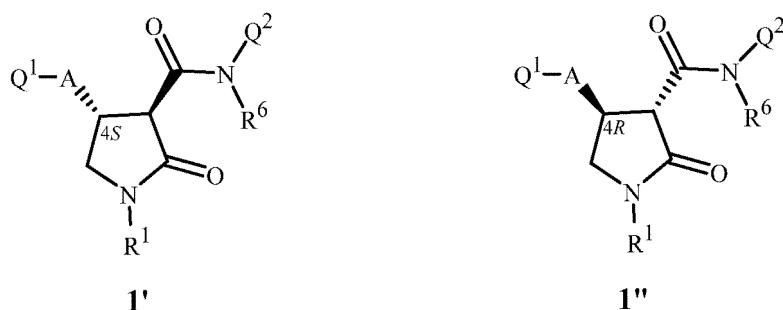
50

本発明の化合物は、1つ以上の立体異性体として存在することができる。様々な立体異性体には、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロブ異性体および幾何異性体が含まれる。立体異性体は、同一構造であるが、空間内のそれらの原子の配列が異なる異性体であり、エナンチオマー、ジアステレオマー、シス・トランス異性体（幾何異性体としても公知である）およびアトロブ異性体が含まれる。アトロブ異性体は、回転障壁が異性体種の単離を許容するほど十分に高い単結合の周囲での制限された回転の結果として生じる。当業者であれば、1つの立体異性体は、他の立体異性体と比較して富化されている場合、または他の立体異性体から分離されている場合により活性である可能性がある、および／または有益な効果を示す可能性があることを理解するであろう。さらに、当業者であれば、前記立体異性体を分離する、富化する、および／または選択的に調製する方法を知っている。本発明の化合物は、立体異性体の混合物、個別立体異性体または光学活性形として存在する場合がある。特にR⁴およびR⁵がそれぞれHである場合、C(O)N(Q²)(R⁶)およびQ¹置換基は、典型的にはほとんどが環状アミド環上の熱力学的に好ましいトランス配置にある。

【0035】

例えれば、環状アミド環の3位で炭素に結合しているC(O)N(Q²)(R⁶)部分（すなわち、Y¹およびY²のそれぞれがOであり；およびJが-CR²R³であり；およびR²がHであり；およびR³がHである場合）および（環状アミド環の4位で炭素に結合している）-A-Q¹は、一般にトランス配置で見いだされる。それぞれの3位および4位の両方の炭素原子は、キラル中心を有する。最も優勢な対のエナンチオマーは、式1'および式1''として描出されている。本発明はすべての立体異性体に関するが、生物学的運用性のために好ましいエナンチオマー対は、式1'として特定されている。当業者であれば、特定のキラル中心にある名称またはRもしくはSがその中心にある特定置換パターンの関数であることを理解するであろう。このため式1'および1''の化合物については、A変量の数値に依存して逆転することがあり得る。立体異性のすべての態様の包括的考察については、Ernest L. Eliel and Samuel H. Wilen, Stereochemistry of Organic Compounds, John Wiley & Sons, 1994を参照されたい。

【化7】



【0036】

本明細書に描出した分子的記述は、立体化学を描出すための標準的慣例にしたがっている。立体配置を示すために、図面の紙面から見ている者に向かって立ち上がる結合は、実線の楔形で示されているが、ここで楔の幅広い側は見ている者に向かって図面の紙面の上方にある原子に結合している。図面の紙面の下方へ向かって見ている者から離れていく結合は破線の楔によって示されているが、ここで楔の狭い側は見ている者からさらに離れている原子に結合している。一定幅の線は、実線または破線の楔で示されている結合に対して、反対方向または中立方向の結合を示し；一定幅の線はまた、特定の立体構造を示すことが意図されていない分子または分子の部分における結合もまた示している。

【0037】

本発明は、ラセミ混合物、例えば、式1'および1''の等量のエナンチオマーを含む。さらに、本発明は、式1のエナンチオマー内のラセミ混合物に比較して富化されている

10

20

30

40

50

混合物を含む。さらに、式1の化合物の本質的に純粋なエナンチオマー、例えば、式1'、および式1''が含まれる。

【0038】

鏡像異性体的に富化（すなわち、エナンチオ富化）された場合、1つのエナンチオマーは他方のエナンチオマーより大量で存在し、富化の程度は、 $(2x - 1) \cdot 100\%$ （式中、 x は混合物中の優勢エナンチオマーのモル分率である）として定義される、エナンチオマー過剰（「e e」）という表現によって定義できる（例えば、20%のeeは、エナンチオマーの60:40比に対応する）。

【0039】

好ましくは、本発明の組成物は、より活性な異性体の少なくとも50%のエナンチオマー過剰；より好ましくは、少なくとも75%のエナンチオマー過剰；いっそうより好ましくは少なくとも90%のエナンチオマー過剰；および最も好ましくは少なくとも94%のエナンチオマー過剰を有する。特に注目すべきは、より活性な異性体の鏡像異性体的に純粋な実施形態である。

【0040】

式1の化合物は、追加のキラル中心を含むことができる。例えば、置換基および他の分子成分、例えばR⁷およびR¹⁰は、それら自体がキラル中心を含有する可能性がある。本発明は、ラセミ混合物ならびにこれらの追加のキラル中心で富化された、および本質的に純粋な立体配置を含む。

【0041】

本発明の化合物は、式1においてアミド結合の周囲での制限された回転のために1つ以上の立体配座異性体（例えば、C(O)N(Q²)(R⁶)（式中、Y¹はOである））として存在することができる。本発明は、配座異性体の混合物を含む。さらに、本発明は、他方に比較して一方の配座異性体において富化している化合物を含む。

【0042】

式1の化合物は、典型的には2つ以上の形態で存在するので、そこで式1は、それらが表す化合物のすべての結晶形態および非結晶形態を含む。非結晶形態には、例えばワックスやゴムなどの固体である実施形態ならびに例えば液剤や融液などの液体である実施形態が含まれる。結晶形態には、本質的に単一結晶型を表す実施形態および多形体の混合物（すなわち、異なる結晶型）を表す実施形態が含まれる。用語「多形体」は、異なる結晶性形態で結晶化することができる化合物の特定の結晶性形態を言い、これらの形態は、結晶格子で分子の異なる配置および/または立体配置を有する。多形体は同一化学組成を有する可能性があるが、それらは格子内で弱く、もしくは強く結合している可能性がある共結晶化水もしくは他の分子の存在もしくは非存在のために組成が相違する可能性もある。多形体は、例えば、結晶の形状、密度、硬度、色、化学的安定性、融点、吸湿性、懸濁性、溶出速度および生物学的利用率などの化学的、物理的および生物学的特性が相違する可能性がある。当業者であれば、式1の化合物の多形体が、式1の同一化合物の他の多形体または多形体の混合物に比較して、有益な効果（例えば、有用な調製物の調製のための適合性、改善された生物学的性能）を示せることを理解するであろう。式1の化合物の特定多形体の調製および単離は、例えば、選択される溶媒および温度を使用する結晶化法を含む当業者には公知の方法によって達成できる。多形性の包括的考察については、R. H. I. f i k e r , E d . , P o l y m o r p h i s m i n t h e P h a r m a c e u t i c a l I n d u s t r y , W i l e y - V C H , W e i n h e i m , 2 0 0 6 を参照されたい。

【0043】

当業者であれば、窒素は酸化物へ酸化するためには利用可能な孤立電子対を必要とするので、すべての窒素含有複素環がN-オキシドを形成できるわけではないことを理解するであろう；当業者であれば、N-オキシドを形成できる窒素含有複素環を認識できるであろう。当業者であれば、さらに第3級アミンがN-オキシドを形成できることも認識できるであろう。複素環および第3級アミンのN-オキシドを調製するための、複素環および

10

20

30

40

50

第3級アミンの例えは過酢酸およびm-クロル過安息香酸(MCPBA)、過酸化水素などのペルオキシ酸、t-ブチルヒドロペルオキシドなどのアルキルヒドロペルオキシド、過ホウ酸ナトリウムおよびジメチルジオキシランなどのジオキシラン類を用いた酸化を含む合成方法は、当業者には極めてよく知られている。N-オキシドのこれらの製造方法は、文献に広範に記載され、レビューされており、例えは：T. L. Gilchrist, Comprehensive Organic Synthesis, vol. 7, pp 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tissler and B. Stanovnik, Comprehensive Heterocyclic Chemistry, vol. 3, pp 18-20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene, Advances in Heterocyclic Chemistry, vol. 43, pp 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tissler and B. Stanovnik, Advances in Heterocyclic Chemistry, vol. 9, pp 285-291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press; ならびにG. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk, Advances in Heterocyclic Chemistry, vol. 22, pp 390-392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Pressを参照されたい。10

【0044】

当業者であれば、環境および生理学的条件下では、化学化合物の塩はそれらの対応する非塩形と平衡状態にあるために、塩は非塩形の生物学的実用性を共有することを認識している。したがって式1の化合物の極めて様々な塩は、望ましくない植生を防除するために有用である(すなわち、農業に好適である)。式1の化合物の塩には、無機酸もしくは有機酸、例えは臭化水素酸、塩酸、硝酸、リン酸、硫酸、酢酸、酪酸、フマル酸、乳酸、マレイン酸、マロン酸、シュウ酸、プロピオン酸、サリチル酸、酒石酸、4-トルエンスルホン酸もしくは吉草酸との酸付加塩が含まれる。式1の化合物が例えはカルボン酸もしくはフェノールなどの酸性部分を含有する場合、塩はさらに例えはピリジン、トリエチルアミンもしくはアンモニアなどの有機もしくは無機塩基とともに形成された塩、またはナトリウム、カリウム、リチウム、カルシウム、マグネシウムもしくはバリウムのアミド、無水物、水酸化物もしくは炭酸塩も含む。したがって、本発明は、式1、そのN-オキシドおよび農業に好適な塩を含む。20

【0045】

発明の概要において記載した本発明の実施形態には、下記が含まれる(下記の実施形態において使用される式1は、そのN-オキシドおよび塩を含む)。

【0046】

実施形態1. 式1(式中、Aは、-CH₂-、-CH₂O-、-CH₂N-、-OCH₂-、-NCH₂-、-CH=CH-、-C-C-、-NH-、-O-、-S-、-SO-もしくは-SO₂- (式中、左側に突き出ている自由結合は、AからQ¹への接続点を指し、右側に突き出ている自由結合は、Aから式1の残りへの接続点を指す)である)の化合物。30

【0047】

実施形態2. 実施形態1(式中、Aは、-CH₂-、-CH₂O-、-CH₂N-、OC_H₂-、-NCH₂-、-CH=CH-、-C-C-、-N-もしくは-O-である)の化合物。

【0048】

実施形態3. 実施形態2(式中、Aは、-CH₂-である)の化合物。

【0049】

実施形態4. 式1または実施形態1～実施形態3(式中、Q¹は、各環もしくは環系が、40

炭素原子環員上の R^7 から独立して選択され、窒素原子環員上の R^9 から選択される 5 個までの置換基で任意選択的に置換された 5 ~ 6 員の芳香族複素環または 8 ~ 10 員の芳香族複素環式二環系である) のいずれか 1 つの化合物。

【0050】

実施形態 5 . 式 1 または実施形態 1 ~ 実施形態 3 (式中、 Q^1 は、各環もしくは環系が、 R^7 から独立して選択される 4 個までの置換基で任意選択的に置換されたフェニル環もしくはナフタレニル環系である) のいずれか 1 つの化合物。

【0051】

実施形態 6 . 実施形態 5 (式中、 Q^1 は、 R^7 から独立して選択される 2 個までの置換基で置換されたフェニル環である) の化合物。 10

【0052】

実施形態 7 . 実施形態 6 (式中、 Q^1 は、 R^7 から選択された 1 個の置換基で置換されたフェニル環である) の化合物。

【0053】

実施形態 8 . 式 1 または実施形態 1 ~ 実施形態 7 (式中、 Q^2 が 5 ~ 6 員の芳香族複素環または 8 ~ 10 員の芳香族複素環式二環系である場合、各環もしくは環系は、炭素原子環員上の R^{10} から独立して選択される、および窒素原子環員上の R^{11} から選択される 5 個までの置換基で任意選択的に置換されている) のいずれか 1 つの化合物。

【0054】

実施形態 9 . 式 1 または実施形態 1 ~ 実施形態 7 (式中、 Q^2 は、 R^{10} から独立して選択される 4 個までの置換基で置換されたフェニル環である) のいずれか 1 つの化合物。 20

【0055】

実施形態 10 . 実施形態 9 (式中、 Q^2 は、 R^{10} から独立して選択される 3 個までの置換基で置換されたフェニル環である) の化合物。

【0056】

実施形態 11 . 実施形態 10 (式中、 Q^2 は、 R^{10} から独立して選択される 2 個までの置換基で置換されたフェニル環である) の化合物。

【0057】

実施形態 12 . 実施形態 9 (式中、 Q^2 は、オルト位で R^{10} から選択される少なくとも 1 個の置換基 (および任意選択的に他の置換基) を有するフェニル環である) の化合物。 30

【0058】

実施形態 13 . 実施形態 12 (式中、 Q^2 は、 R^{10} から選択された 2 個の置換基を有するフェニル環であり、前記置換基の一方はオルト位にあり、他方の前記置換基はメタもしくはパラ位にある) の化合物。

【0059】

実施形態 14 . 実施形態 10 (式中、 Q^2 が、 R^{10} から選択される 3 個の置換基で置換されたフェニル環である場合は、これら 3 個の置換基が (フェニル環の) オルト (例えば、2) 位、メタ (例えば、3) 位およびパラ (例えば、4) 位にある) の化合物。

【0060】

実施形態 15 . 式 1 または実施形態 1 ~ 実施形態 14 (式中、 Y^1 は、O である) のいずれか 1 つの化合物。 40

【0061】

実施形態 16 . 式 1 または実施形態 1 ~ 実施形態 15 (式中、 Y^2 は、O である) のいずれか 1 つの化合物。

【0062】

実施形態 17 . 式 1 または実施形態 1 ~ 実施形態 16 (式中、 Y^1 および Y^2 は、どちらも O である) のいずれか 1 つの化合物。

【0063】

実施形態 18 . 式 1 または実施形態 1 ~ 実施形態 17 (式中、 J は、 - $C R^2 R^3$ - である) のいずれか 1 つの化合物。 50

【0064】

実施形態19. 式1または実施形態1～実施形態17(式中、Jは、-CR²R³-CR^{2a}R^{3a}-である)のいずれか1つの化合物。

【0065】

実施形態20. 式1または実施形態1～実施形態19(式中、R¹は、H、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、ホルミル、C₃～C₈アルキルカルボニルアルキル、-C(C₁～C₄アルキル)=N-O(C₁～C₄アルキル)、-C(O)NH₂、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₃～C₆アルキニル、C₂～C₆シアノアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₄～C₈シクロアルキルアルキル、C₂～C₈アルコキシアルキル、C₃～C₈アルコキシアルコキシアルキルもしくはC₂～C₈ハロアルコキシアルキルである)のいずれか1つの化合物。 10

【0066】

実施形態21. 実施形態20(式中、R¹は、H、ヒドロキシ、アミノ、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₃～C₆アルキニル、C₂～C₆シアノアルキル、C₃～C₆シクロアルキルもしくはC₄～C₈シクロアルキルアルキルである)の化合物。

【0067】

実施形態22. 実施形態21(式中、R¹は、H、C₁～C₆アルキルもしくはC₁～C₆ハロアルキルである)の化合物。

【0068】

実施形態23. 実施形態22(式中、R¹は、H、Me、EtもしくはCHF₂である)の化合物。 20

【0069】

実施形態24. 実施形態23(式中、R¹は、H、MeもしくはEtである)の化合物。

【0070】

実施形態25. 実施形態24(式中、R¹は、Hである)の化合物。

【0071】

実施形態26. 実施形態24(式中、R¹は、Meである)の化合物。

【0072】

実施形態27. 式1または実施形態1～実施形態26(式中、R²は、HもしくはCH₃である)のいずれか1つの化合物。 30

【0073】

実施形態28. 実施形態27(式中、R²は、Hである)の化合物。

【0074】

実施形態29. 式1または実施形態1～実施形態28(式中、R³は、HもしくはCH₃である)のいずれか1つの化合物。

【0075】

実施形態30. 実施形態29(式中、R³は、Hである)の化合物。

【0076】

実施形態31. 式1または実施形態1～実施形態30(式中、R^{2a}は、HもしくはCH₃である)のいずれか1つの化合物。 40

【0077】

実施形態32. 実施形態31(式中、R^{2a}は、Hである)の化合物。

【0078】

実施形態33. 式1または実施形態1～実施形態32(式中、R^{3a}は、HもしくはCH₃である)のいずれか1つの化合物。

【0079】

実施形態34. 実施形態33(式中、R^{3a}は、Hである)の化合物。

【0080】

実施形態35. 式1または実施形態1～実施形態34(式中、R⁴は、HもしくはCH₃) 50

である)のいずれか1つの化合物。

【0081】

実施形態36. 実施形態35(式中、R⁴は、Hである)の化合物。

【0082】

実施形態37. 式1または実施形態1~実施形態36(式中、R⁵は、HもしくはCH₃である)のいずれか1つの化合物。

【0083】

実施形態38. 実施形態37(式中、R⁵は、Hである)の化合物。

【0084】

実施形態39. 式1または実施形態1~実施形態38(式中、R⁶は、H、ヒドロキシ、アミノ、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₃~C₆アルキニル、C₂~C₈アルコキシアルキル、C₃~C₈アルコキシアルコキシアルキルもしくはC₂~C₈ハロアルコキシアルキルである)のいずれか1つの化合物。 10

【0085】

実施形態40. 実施形態39(式中、R⁶は、HもしくはCH₃である)の化合物。

【0086】

実施形態41. 実施形態40(式中、R⁶は、Hである)の化合物。

【0087】

実施形態42. 式1または実施形態1~実施形態41(式中、各R⁷は、独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₈アルキル、C₂~C₈シアノアルキル、C₁~C₈シアノアルコキシ、C₁~C₈ハロアルキル、C₂~C₈アルケニル、C₂~C₈ハロアルケニル、C₂~C₈アルキニル、C₂~C₈ハロアルキニル、C₁~C₈ニトロアルキル、C₂~C₈ニトロアルケニル、C₂~C₈アルコキシアルキル、C₃~C₈アルコキシアアルコキシアルキル、C₂~C₈ハロアルコキシアルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、C₄~C₁₀シクロアルキルアルキル、C₄~C₁₀アルキルシクロルアルキル、C₁~C₈アルコキシ、C₁~C₈ハロアルコキシ、C₂~C₈アルケニルオキシ、C₂~C₈ハロアルケニルオキシ、C₃~C₈アルキニルオキシ、C₃~C₈ハロアルキニルオキシ、C₃~C₈シクロアルコキシ、C₁~C₈アルキルチオ、C₁~C₈ハロアルキルチオ、C₁~C₈アルキルスルフィニル、C₁~C₈ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₈アルキルスルホニル、C₁~C₈ハロアルキルスルホニル、ヒドロキシ、ホルミル、C₂~C₈アルキルカルボニル、C₂~C₈アルキルカルボニルオキシ、C₁~C₈アルキルスルホニルオキシ、C₁~C₈ハロアルキルスルホニルオキシ、アミノ、C₁~C₄アルキルアミノ、C₂~C₄ジアルキルアミノ、ホルミルアミノ、C₂~C₄アルキルカルボニルアミノ、-SF₅、-SCN、C₃~C₁₂トリアルキルシリル、トリメチルシリルメチルもしくはトリメチルシリルメトキシである)のいずれか1つの化合物。 20

【0088】

実施形態43. 実施形態42(式中、各R⁷は、独立してハロゲン、シアノ、C₁~C₂アルキル、C₁~C₃ハロアルキルもしくはC₁~C₃アルキルスルホニルである)の化合物。 40

【0089】

実施形態44. 実施形態43(式中、R⁷は、独立してハロゲンもしくはC₁~C₂ハロアルキルである)の化合物。

【0090】

実施形態45. 実施形態44(式中、各R⁷は、独立してハロゲンもしくはCF₃である)の化合物。

【0091】

実施形態46. 実施形態45(式中、各R⁷は、独立してF、C₁もしくはCF₃である)の化合物。

【0092】

50

実施形態 4 7 . 式 1 または実施形態 1 ~ 実施形態 4 6 (式中、各 R^{1~0} は、独立してハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、C₁ ~ C₈ アルキル、C₂ ~ C₈ シアノアルキル、C₁ ~ C₈ シアノアルコキシ、C₁ ~ C₈ ハロアルキル、C₂ ~ C₈ アルケニル、C₂ ~ C₈ ハロアルケニル、C₂ ~ C₈ アルキニル、C₂ ~ C₈ ハロアルキニル、C₁ ~ C₈ ニトロアルキル、C₂ ~ C₈ アルコキシアルキル、C₃ ~ C₈ アルコキシアルコキシアルキル、C₂ ~ C₈ ハロアルコキシアルキルもしくはC₃ ~ C₈ シクロアルキルである) のいずれか 1 つの化合物。

【0093】

実施形態 4 8 . 実施形態 4 7 (式中、各 R^{1~0} は、独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ ~ C₂ アルキル、C₁ ~ C₃ ハロアルキルもしくはC₁ ~ C₃ アルキルスルホニルである) の化合物。 10

【0094】

実施形態 4 9 . 実施形態 4 8 (式中、各 R^{1~0} は、独立してハロゲンもしくはC₁ ~ C₂ ハロアルキルである) の化合物。

【0095】

実施形態 5 0 . 実施形態 4 9 (式中、各 R^{1~0} は、独立してハロゲンもしくはCF₃ である) の化合物。 20

【0096】

実施形態 5 1 . 実施形態 5 0 (式中、各 R^{1~0} は、独立して F もしくは CF₃ である) の化合物。

【0097】

実施形態 5 2 . 実施形態 5 1 (式中、各 R^{1~0} は、独立して F である) の化合物。

【0098】

実施形態 5 3 . 実施形態 1 、 2 もしくは 4 ~ 5 2 (式中、A は、 -CH₂- 、 - (CH₂)₂C(=O)NH- 、 -CH₂CH₂- 、 -C(=O)NH- 、 CH₂NH- 、 -OC(H₂)₂- 、 -NHC(H₂)₂- 、 -CH=CH- 、 -C-C- 、 -N- 、 -O- 、 -S- 、 -SO- もしくは -SO₂- (式中、左側に突き出ている自由結合は、A から Q¹ への接続点を指し、右側に突き出している自由結合は、A から式 1 の残りへの接続点を指す) である) のいずれか 1 つの化合物。

【0099】

実施形態 5 4 . 実施形態 5 4 (式中、A は、 -CH₂- 、 -CH₂CH₂- 、 -C(=O)NH- 、 -CH=CH- もしくは -C-C- (式中、左側に突き出ている結合は、Q¹ 部分に接続されており、右側に突き出ている結合は、式 1 の残りの部分の窒素に接続されている) である) の化合物。 30

【0100】

実施形態 5 5 . 実施形態 5 4 (式中、A は、 -CH₂- 、 -CH₂CH₂- 、 -CH=C(H)- もしくは -C-C- である) の化合物。

【0101】

実施形態 5 6 . 実施形態 5 5 (式中、A は、 -CH₂- である) の化合物。 40

【0102】

実施形態 5 7 . 実施形態 5 5 (式中、A は、 -CH₂CH₂- である) の化合物。

【0103】

実施形態 5 8 . 実施形態 5 6 (式中、A は、 -CH=CH- である) の化合物。

【0104】

実施形態 5 9 . 実施形態 5 6 (式中、A は、 -C-C- である) の化合物。

【0105】

実施形態 6 0 . 実施形態 1 (式中、Q¹ は、各環系が、炭素原子ならびに 2 個までの O 原子および 2 個までの N 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から任意選択的に選択される環員を含有する 8 ~ 10 員の芳香族複素環式二環系であり、ここで 3 個までの炭素環員は、C(=O) および C(=S) から独立して選択され、各環系は、炭素原子 50

環員上の R⁷ から独立して選択され、および窒素原子環員上の R⁹ から選択される 4 個までの置換基で任意選択的に置換される) の化合物。

【 0 1 0 6 】

実施形態 6 1 . 実施形態 6 0 (式中、 Q¹ は、各環系が、炭素原子ならびに 2 個までの O 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有する 8 ~ 9 員の芳香族複素環式二環系であり、各環系は、炭素原子環員上の R⁷ から独立して選択される 4 個までの置換基で任意選択的に置換されている) の化合物。

【 0 1 0 7 】

実施形態 6 2 . 実施形態 6 1 (式中、 Q¹ は、炭素原子および 2 個までの O 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有する 9 員の芳香族複素環式二環系であり、各環系は、炭素原子環員上の R⁷ から独立して選択された 4 個までの置換基で任意選択的に置換されている) の化合物。

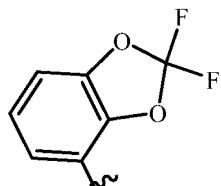
【 0 1 0 8 】

実施形態 6 3 . 実施形態 6 2 (式中、 Q¹ は、炭素原子および 2 個の O 原子から選択される環員を含有する 9 員の芳香族複素環式二環系であり、系は炭素原子環員上の R⁷ (すなわち、明細表 2 内の U - 8 1) から独立して選択される 3 個までの置換基で任意選択的に置換されている) の化合物。

【 0 1 0 9 】

実施形態 6 4 . 実施形態 6 3 (式中、 Q¹ は、 U - 8 1 A である) の化合物。

【 化 8 】



U-81A

【 0 1 1 0 】

実施形態 6 5 . 式 1 または実施形態 1 ~ 3 、 5 もしくは 8 ~ 6 4 (式中、 Q¹ は、 R⁷ から独立して選択される 1 ~ 4 個の置換基で任意選択的に置換されたフェニル環 ; または炭素原子ならびに炭素原子環員上の R⁷ から独立して選択される、および窒素原子環員上の R⁹ から選択される 4 個までの置換基で任意選択的に置換された、 2 個までの O 原子、 2 個までの S 原子および 4 個までの N 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有する 5 ~ 6 員の芳香族複素環である) のいずれか 1 つの化合物。

【 0 1 1 1 】

実施形態 6 6 . 式 1 または実施形態 1 ~ 7 もしくは 1 5 ~ 6 5 (式中、 Q² は、 R^{1 0} から独立して選択される 5 個までの置換基で任意選択的に置換されたフェニル環 ; または各環が炭素原子ならびに 2 個までの O 原子、 2 個までの S 原子および 4 個までの N 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有する 5 ~ 6 員の完全不飽和複素環であり、各環もしくは環系は、炭素原子環員上の R^{1 1} から独立して選択される、および窒素原子環員上の R^{1 1} から選択される 5 個までの置換基で任意選択的に置換されている) のいずれか 1 つの化合物。

【 0 1 1 2 】

実施形態 6 7 . 実施形態 6 6 (式中、 Q² は、 R^{1 0} から独立して選択される 5 個までの置換基で任意選択的に置換されたフェニル環 ; または各環が炭素原子ならびに 4 個までの N 原子から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子から選択される環員を含有する 6 員の完全不飽和複素環であり、各環もしくは環系は、炭素原子環員上の R^{1 1} から独立して選択される 5 個までの置換基で任意選択的に置換されている) の化合物。

【 0 1 1 3 】

10

20

40

50

実施形態 6 8 . 実施形態 6 7 (式中、Q²は、R^{1 0}から独立して選択される4個までの置換基で任意選択的に置換されたフェニル環；または炭素原子環員上のR^{1 1}から独立して選択される4個までの置換基で任意選択的に置換されたピリジル環である)の化合物。

【0114】

実施形態 6 9 . 実施形態 6 8 (式中、Q²は、炭素原子環員上のR^{1 0}から独立して選択される3個までの置換基で任意選択的に置換された3-ピリジル環である)の化合物。

【0115】

実施形態 7 0 . 実施形態 6 9 (式中、Q²は、C₁～C₈アルキルもしくはC₁～C₈ハロアルキルから独立して選択される3個までの置換基で任意選択的に置換された3-ピリジル環である)の化合物。 10

【0116】

実施形態 7 1 . 式 1 (式中、Aは、-CH₂-、-CH₂O-、-CH₂NH-、-OC
H₂-、-NHCH₂-、-CH=CH-、-C=C-、-NH-、-O-、-S-、-SO-もしくは-SO₂- (式中、左側に突き出ている自由結合は、AからQ¹への接続点を指し、右側に突き出ている自由結合は、Aから式1の残りへの接続点を指す)である)の化合物。

【0117】

実施形態 7 2 . 式 2 (式中、Aは、-CH₂-、-CH₂O-、-CH₂NH-、OCH₂-、-NHCH₂-、-CH=CH-、-C=C-、-NH-もしくは-O-である)の化合物。 20

【0118】

実施形態 7 3 . 式 1 (式中、Aは、-ON=CH-、-ON=C(CH₃)-、-NHN
=CH-、-NHN=C(CH₃)-、-N=CH-、-N=C(CH₃)-、-CH=NO-、-C(CH₃)=NO-、-CH=NNH-、-C(CH₃)=NNH-、-C
H=N-、-C(CH₃)=N-、-CH₂CH₂CH₂-、-CH₂CH₂-、-CH₂-、-CF₂-、-C(=O)-、-CH=CH-、-CH=CHCH₂-、-CH₂
CH=CH-、-C=C-、-C CCH₂-、-CH₂C C-、-CH₂CH₂O-、-CH₂O-、-O-、-OCH₂CH₂-、-OCH₂-、-CH₂CH₂S-、-CH₂S-、-S-、-SO-、-SO₂-、-SCH₂CH₂-、-SCH₂-、-C
H₂CH₂NH-、-CH₂NH-、-NH-、-NHCH₂-および-NHCH₂CH₂- (式中、左側に突き出ている結合はQ¹部分に接続されており、右側に突き出ている結合は式1の残りに接続されている)から独立して選択される)の化合物。 30

【0119】

実施形態 7 4 . 実施形態 7 3 (式中、Aは、-ON=CH-、-ON=C(CH₃)-、
-NHN=CH-、-NHN=C(CH₃)-、-N=CH-、-N=C(CH₃)-、
-CH=NO-、-C(CH₃)=NO-、-CH=NNH-、-C(CH₃)=NNH-、
-CH=N-および-C(CH₃)=N-から選択される)の化合物。

【0120】

実施形態 7 5 . 実施形態 7 4 (式中、Aは、-ON=CH-、-ON=C(CH₃)-、
-NHN=CH-、-NHN=C(CH₃)-、-N=CH-および-N=C(CH₃)
-から選択される)の化合物。 40

【0121】

実施形態 7 6 . 実施形態 7 4 (式中、Aは、-CH=NO-、C(CH₃)=NO-、
-CH=NNH-、-C(CH₃)=NNH-、-CH=N-および-C(CH₃)=N-
から独立して選択される)の化合物。

【0122】

実施形態 7 7 . 式 1 (式中、R^{1 5}は、C₄～C₈シクロアルキルアルキル以外である)の化合物。

【0123】

上の実施形態 1～77ならびに本明細書に記載される任意の他の実施形態を含む、本発 50

明の実施形態は、任意の方法で組み合わせることができ、実施形態における変数の記載は、式1の化合物にのみならず、式1の化合物を製造するのに有用な出発化合物および中間化合物にも関連する。さらに、上の実施形態1～77ならびに本明細書に記載される任意の他の実施形態、ならびにそれらの任意の組み合わせを含む、本発明の実施形態は、本発明の組成物および方法に関連する。

【0124】

実施形態1～77の組み合わせは、以下によって例示される。

【0125】

実施形態A.式1(式中、

Aは、-CH₂-、-CH₂O-、-CH₂NH-、-OCH₂-、-NHCH₂-、
-CH=CH-、-C=C-、-NH-もしくは-O-(式中、左側に突き出ている自由結合は、AからQ¹への接続点を指し、右側に突き出ている自由結合は、Aから式1の残りへの接続点を指す)であり；

Q¹は、R⁷から独立して選択される2個までの置換基で置換されたフェニル環であり；

Q²は、R^{1～0}から独立して選択される3個までの置換基で置換されたフェニル環であり；

Y¹およびY²は、どちらもOであり；および

Jは、-CR²R³-である)の化合物。

【0126】

実施形態B.式1(式中、

Aは、-CH₂-、-CH₂O-、-CH₂NH-、-OCH₂-、-NHCH₂-、
-CH=CH-、-C=C-、-NH-もしくは-O-(式中、左側に突き出ている自由結合は、AからQ¹への結合点を指し、右側に突き出ている自由結合は、Aから式1の残りへの結合点を指す)であり；

Q¹は、R⁷から独立して選択される2個までの置換基で置換されたフェニル環であり；

Q²は、R^{1～0}から独立して選択される3個までの置換基で置換されたフェニル環であり；

Y¹およびY²は、どちらもOであり；および

Jは、-CR²R³-CR²^aR³^a-である)の化合物。

【0127】

実施形態C.実施形態A(式中、

Aは、-CH₂-であり；

R¹は、H、MeもしくはEtであり；

R²は、Hであり；

R³は、Hであり；

R⁴は、Hであり；

R⁵は、Hであり；

R⁶は、Hであり；

R⁷は、独立して、独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₈アルキル、C₂～C₈シアノアルキル、C₁～C₈シアノアルコキシ、C₁～C₈ハロアルキル、C₂～C₈アルケニル、C₂～C₈ハロアルケニル、C₂～C₈アルキニル、C₂～C₈ハロアルキニル、C₁～C₈ニトロアルキル、C₂～C₈ニトロアルケニル、C₂～C₈アルコキシアルキル、C₃～C₈アルコキシアラルコキシアルキル、C₂～C₈ハロアルコキシアラルキル、C₃～C₈シクロアルキル、C₃～C₈ハロシクロアルキル、C₄～C₁₀シクロアルキルアルキル、C₄～C₁₀アルキルシクロルアルキル、C₁～C₈アルコキシ、C₁～C₈ハロアルコキシ、C₂～C₈アルケニルオキシ、C₂～C₈ハロアルケニルオキシ、C₃～C₈アルキニルオキシ、C₃～C₈ハロアルキニルオキシ、C₃～C₈シクロアルコキシ、C₁～C₈アルキルチオ、C₁～C₈ハロアルキルチオ、C₁～C₈アルキ

50

ルスルフィニル、C₁～C₈ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₈アルキルスルホニル、C₁～C₈ハロアルキルスルホニル、ヒドロキシ、ホルミル、C₂～C₈アルキルカルボニル、C₂～C₈アルキルカルボニルオキシ、C₁～C₈アルキルスルホニルオキシ、C₁～C₈ハロアルキルスルホニルオキシ、アミノ、C₁～C₄アルキルアミノ、C₂～C₄ジアルキルアミノ、ホルミルアミノ、C₂～C₄アルキルカルボニルアミノ、-SF₅、-SCN、C₃～C₁₂トリアルキルシリル、トリメチルシリルメチルもしくはトリメチルシリルメトキシであり；および

R¹は、独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₂アルキル、C₁～C₃ハロアルキルもしくはC₁～C₃アルキルスルホニルである)の化合物。

【0128】

実施形態D. 実施形態B(式中、

Aは、-CH₂-であり；

R¹は、H、MeもしくはEtであり；

R²は、Hであり；

R³は、Hであり；

R^{2a}は、Hであり；

R^{3a}は、Hであり；

R⁴は、Hであり；

R⁵は、Hであり；

R⁶は、Hであり；

R⁷は、独立して、独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₈アルキル、C₂～C₈シアノアルキル、C₁～C₈シアノアルコキシ、C₁～C₈ハロアルキル、C₂～C₈アルケニル、C₂～C₈ハロアルケニル、C₂～C₈アルキニル、C₂～C₈ハロアルキニル、C₁～C₈ニトロアルキル、C₂～C₈ニトロアルケニル、C₂～C₈アルコキシアルキル、C₃～C₈アルコキシアルコキシアルキル、C₂～C₈ハロアルコキシアルキル、C₃～C₈シクロアルキル、C₃～C₈ハロシクロアルキル、C₄～C₁₀シクロアルキルアルキル、C₄～C₁₀アルキルシクロルアルキル、C₁～C₈アルコキシ、C₁～C₈ハロアルコキシ、C₂～C₈アルケニルオキシ、C₂～C₈ハロアルケニルオキシ、C₃～C₈シクロアルコキシ、C₁～C₈アルキルチオ、C₁～C₈ハロアルキルチオ、C₁～C₈アルキルスルフィニル、C₁～C₈ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₈アルキルスルホニル、C₁～C₈ハロアルキルスルホニル、ヒドロキシ、ホルミル、C₂～C₈アルキルカルボニル、C₂～C₈アルキルカルボニルオキシ、C₁～C₈アルキルスルホニルオキシ、C₁～C₈ハロアルキルスルホニルオキシ、アミノ、C₁～C₄アルキルアミノ、C₂～C₄ジアルキルアミノ、ホルミルアミノ、C₂～C₄アルキルカルボニルアミノ、-SF₅、-SCN、C₃～C₁₂トリアルキルシリル、トリメチルシリルメチルもしくはトリメチルシリルメトキシであり；および

R¹⁰は、独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₂アルキル、C₁～C₃ハロアルキルもしくはC₁～C₃アルキルスルホニルである)の化合物。

【0129】

実施形態E. 実施形態C(式中、

各R⁷は、独立してハロゲン、シアノ、C₁～C₂アルキル、C₁～C₃ハロアルキルもしくはC₁～C₃アルキルスルホニルであり；および

各R¹⁰は、独立してハロゲンもしくはC₁～C₂アルキルである)の化合物。

【0130】

実施形態F. 実施形態E(式中、

Q¹は、R⁷から独立して選択される1個の置換基で置換されたフェニル環であり；

Q²は、R¹⁰から選択された2個の置換基を有するフェニル環であり、前記置換基の一方はオルト位にあり、他方の前記置換基はメタ位もしくはパラ位にある)の化合物。

【0131】

10

20

30

40

50

実施形態G . 実施形態E (式中、

Q^2 は、 R^{10} から選択される3個の置換基で置換されたフェニル環であり、これら3個の置換基は、フェニル環のオルト位、メタ位およびパラ位にある)の化合物。

【0132】

実施形態H . 式1 (式中、

Aは、 $-ON=CH-$ 、 $-ON=C(CH_3)-$ 、 $-NHN=CH-$ 、 $-NHN=C(CH_3)-$ 、 $-N=CH-$ 、 $-N=C(CH_3)-$ 、 $-CH=NO-$ 、 $-C(CH_3)=NO-$ 、 $-CH=NNH-$ 、 $-C(CH_3)=NNH-$ 、 $-CH=N-$ 、 $-C(CH_3)=N-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-CF_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-CH=CHCH_2-$ 、 $-CH_2CH=CH-$ 、 $-CC-$ 、 $-C(CCH_2)-$ 、 $-CH_2CC-$ 、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2O-$ 、 $-O-$ 、 $-OCH_2CH_2-$ 、 $-OCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2S-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-SCH_2CH_2-$ 、 $-SCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2NH-$ 、 $-CH_2NH-$ 、 $-NH-$ 、 $-NHCH_2-$ および $-NHCH_2CH_2-$ (式中、左側に突き出ている結合は Q^1 部分に接続されており、右側に突き出ている結合は式1の残りに接続されている)から独立して選択され;

Q^1 は、 R^7 から独立して選択される1~4個の置換基で任意選択に置換されたフェニル環;または炭素原子ならびに炭素原子環員上の R^7 から独立して選択される、および窒素原子環員上の R^9 から選択される4個までの置換基で任意選択的に置換された、2個までのO原子、2個までのS原子および4個までのN原子から独立して選択される1~4個のヘテロ原子から選択される環員を含有する5~6員の芳香族複素環であり;

Q^2 は、 R^{10} から独立して選択される5個までの置換基で任意選択に置換されたフェニル環;または炭素原子ならびに2個までのO原子、2個までのS原子および4個までのN原子から独立して選択される1~4個のヘテロ原子から選択される環員を含有する5~6員の芳香族複素環であり、各環もしくは環系は炭素原子環員上の R^{11} から独立して選択される、および窒素原子環員上の R^{11} から選択される5個までの置換基で任意選択的に置換されており;

Y^1 および Y^2 は、どちらもOであり;

R^1 は、H、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、ホルミル、 $C_3 \sim C_8$ アルキルカルボニルアルキル、 $-C(C_1 \sim C_4)$ アルキル)=N-O($C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $-C(O)N$ 、 H_2 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキルもしくは $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキルであり;

R^6 は、H、ヒドロキシ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキルもしくは $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキルであり;

各 R^7 は、独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_8$ シアノアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_8$ ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ニトロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルコキシアルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ シクロアルキルアルキル、 $C_4 \sim C_{10}$ アルキルシクロルアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ アルキニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ ハロアルキニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルフニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキルスルフニル、ヒドロキシ、ホルミル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_8$

⁸ ハロアルキルスルホニルオキシ、アミノ、C₁～C₄アルキルアミノ、C₂～C₄ジアルキルアミノ、ホルミルアミノ、C₂～C₄アルキルカルボニルアミノ、-SF₅、-SCN、C₃～C₁₂トリアルキルシリル、トリメチルシリルメチルもしくはトリメチルシリルメトキシであり；および

各R¹⁰は、独立してハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、C₁～C₈アルキル、C₂～C₈シアノアルキル、C₁～C₈シアノアルコキシ、C₁～C₈ハロアルキル、C₂～C₈アルケニル、C₂～C₈ハロアルケニル、C₂～C₈アルキニル、C₂～C₈ハロアルキニル、C₁～C₈ニトロアルキル、C₂～C₈ニトロアルケニル、C₂～C₈アルコキシアルキル、C₃～C₈アルコキシアルコキシアルキル、C₂～C₈ハロアルコキシアルキルもしくはC₃～C₈シクロアルキルである）の化合物。
10

【0133】

特定の実施形態には：

N-(2,3-ジフルオロフェニル)-4-[(4-フルオロフェニル)メチル]-2-オキソ-3-ピロリジンカルボキサミド（化合物13）；および
4-[(3-クロロフェニル)メチル]-N-(2,3-ジフルオロフェニル)-2-オキソ-3-ピロリジンカルボキサミド（化合物1）からなる群から選択される式1の化合物が含まれる。

【0134】

本発明はさらに、望ましくない植生の成長を防除するための方法であって、植生の場所を除草性有効量の本発明の（例えば、本明細書に記載した組成物としての）化合物と接触させる工程を含む方法に関する。使用方法に関する実施形態として注目すべきは、上述の実施形態の化合物を含むものである。本発明の化合物は、例えば、コムギ、オオムギ、トウモロコシ、ダイズ、ヒマワリ、綿、アブラナおよびイネなどの作物および特に例えばサトウキビ、柑橘類、果実およびナツツ作物などの作物における雑草を選択的に防除するために特に有用である。
20

【0135】

さらに実施形態として注目に値するのは、上述の実施形態の化合物を含む本発明の除草剤組成物である。

【0136】

本発明はさらに、(a)式1から選択される化合物、それらのN-オキシドおよび塩、ならびに(b)(b1)光化学系II阻害剤、(b2)アセトヒドロキシ酸シンターゼ(AHAS)阻害剤、(b3)アセチル-CoAカルボキシラーゼ(ACCase)阻害剤、(b4)オーキシン模倣体、(b5)5-エノール-ピルビルシキミ酸-3-リン酸(EPSp)シンターゼ阻害剤、(b6)光化学系I電子ダイバーター、(b7)プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼ(PPO)阻害剤、(b8)グルタミンシンターゼ(GS)阻害剤、(b9)超長鎖脂肪酸(VLCFA)エロンガーゼ阻害剤、(b10)オーキシン輸送阻害剤、(b11)フィトエンデサチュラーゼ(PDS)阻害剤、(b12)4-ヒドロキシフェニル-ピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)阻害剤、(b13)ホモゲンチジン酸ソレネシルトランセラーゼ(solenesyl transererase)(HST)阻害剤、(b14)セルロース生合成阻害剤、(b15)有糸分裂搅乱物質、有機ヒ素剤、アスマム、プロモブチド、シンメチリン、クミルロン、ダゾメット、ジフェンゾコート、ダイムロン、エトベンザニド、フルレノール、ホサミン、ホサミン-アンモニウム、ヒダントシジン、メタム、メチルダイムロン、オレイン酸、オキサジクロメホン、ペラルゴン酸およびピリブチカルブを含む他の除草剤、および(b16)除草剤毒性緩和剤ならびに(b1)～(b16)の化合物の塩から選択される少なくとも1つの追加の有効成分を含む除草剤混合物を含む。
30
40

【0137】

「光化学系II阻害剤」(b1)は、Q_B-結合ニッチでD-1タンパク質に結合する、したがって葉緑体チラコイド膜におけるQ_AからQ_Bへの電子伝達をブロックする化学化合物である。光化学系IIの通過がブロックされた電子は、一連の反応を介して輸送さ
50

れ、細胞膜を破壊し、葉緑体の膨潤、膜漏出、そして最終的には細胞破壊をもたらす有毒化合物を形成する。Q_B結合ニッチは3つの異なる結合部位を有し：結合部位Aは、アトラジンなどのトリアジン、ヘキサジノンなどのトリアジノン、およびプロマシルなどのウラシルに結合し、結合部位Bは、ジウロンなどのフェニル尿素に結合し、結合部位Cは、ベンタゾンなどのベンゾチアジアゾール、プロモキシニルなどのニトリルおよびピリデートなどのフェニル-ピリダジンに結合する。光化学系II阻害剤の例としては、アメトリン、アミカルバゾン、アトラジン、ベンタゾン、プロマシル、プロモフェノキシム、プロモキシニル、クロルプロムロン、クロリダゾン、クロロトルロン、クロロクスロン、クミルロン、シアナジン、ダイムロン、デスマディファム、デスマトリーン、ジメフロン、ジメタメトリン、ジウロン、エチジムロン、フェヌロン、フルオメツロン、ヘキサジノン、イオキシニル、イソプロツロン、イソウロン、レナシル、リニュロン、メタミトロン、メタベンズチアズロン、メトプロムロン、メトキシウロン、メトリブジン、モノリニュロン、ネブロン、ペンタノクロール、フェンメディファム、プロメトン、プロメトリン、プロパニル、プロパジン、ピリダホル、ピリデート、シズロン、シマジン、シメトリン、テブチウロン、ターバシル、テルブメトン、テルブチラジン、テルブトリンおよびトリエタジンが挙げられる。注目すべきは、アトラジン、プロモキシニルもしくはメトリブジンと混合された本発明の化合物である。

【0138】

「AHAS阻害剤」(b2)は、アセト乳酸シンターゼ(ALS)としても公知のアセトヒドロキシ酸シンターゼ(AHAS)を阻害するので、したがってタンパク質合成および細胞の成長に必要とされる、例えばバリン、ロイシンおよびイソロイシンなどの分岐鎖脂肪族アミノ酸の産生を阻害することによって植物を死滅させる化学化合物である。AHAS阻害剤の例としては、アミドスルフロン、アジムスルフロン、ベンスルフロン-メチル、ビスピリバック-ナトリウム、クロランスラム-メチル、クロリムロン-エチル、クロルスルフロン、シノスルフロン、シクロスルファムロン、ジクロスラム、エタメツルフロン-メチル、エトキシスルフロン、フラザスルフロン、フロラスラム、フルカルバゾン-ナトリウム、フルメツラム、フルピルスルフロン-メチル、フルピルスルフロン-ナトリウム、ホラムスルフロン、ハロスルフロン-メチル、イマザメタベンズ-メチル、イマザモックス、イマザピック、イマザピル、イマザキン、イマゼタピル、イマゾスルフロン、ヨードスルフロン-メチル(ナトリウム塩を含む)、イオフェンスルフロン(2-ヨード-N-[[(4-メトキシ-6-メチル-1,3,5-トリアジン-2-イル)アミノ]カルボニル]ベンゼンスルホンアミド)、メソスルフロン-メチル、メタゾスルフロン(3-クロロ-4-(5,6-ジヒドロ-5-メチル-1,4,2-ジオキサジン-3-イル)-N-[(4,6-ジメトキシ-2-ピリミジニル)アミノ]カルボニル]-1-メチル-1H-ピラゾール-5-スルホンアミド)、メトラスラム、メトスルフロン-メチル、ニコスルフロン、オキサスルフロン、ペノキススラム、プリミスルフロン-メチル、プロポキシカルバゾン-ナトリウム、プロピリスルフロン(2-クロロ-N-[(4,6-ジメトキシ-2-ピリミジニル)アミノ]カルボニル]-6-プロピルイミダゾ[1,2-b]ピリダジン-3-スルホンアミド)、プロスルフロン、ピラゾスルフロン-エチル、ピリベンゾキシム、ピリフタリド、ピリミノバッカ-メチル、ピリチオバッカ-ナトリウム、リムスルフロン、スルホメツロン-メチル、スルホスルフロン、チエンカルバゾン、チフェンスルフロン-メチル、トリアファモン(N-[(2-[(4,6-ジメトキシ-1,3,5-トリアジン-2-イル)カルボニル]-6-フルオロフェニル]-1,1-ジフルオロ-N-メチルメタンスルホンアミド)、トリアスルフロン、トリベニユロン-メチル、トリフロキシスルフロン(ナトリウム塩を含む)、トリフルスルフロン-メチルおよびトリトスルフロンが挙げられる。注目すべきは、ニコスルフロン、フルピルスルフロンもしくはクロリムロンと混合された本発明の化合物である。

【0139】

「ACCase阻害剤」(b3)は、植物における脂質および脂肪酸合成の早期工程を触媒するアセチル-CoAカルボキシラーゼ酵素を阻害する化学化合物である。脂質は細

10

20

30

40

50

胞膜の必須成分であり、脂質なしで新しい細胞を生成することはできない。アセチル C o A カルボキシラーゼの阻害とその後の脂質産生の不足は、特に分裂組織などの活発な成長領域における細胞膜の完全性の消失をもたらす。最終的には芽や根茎の成長が止まり、芽の分裂組織および根茎の芽が枯れ始める。A C C a s e 阻害剤の例としては、アロキシジム、ブトロキシジム、クレトジム、クロジナホップ、シクロキシジム、シハロホップ、ジクロホップ、フェノキサプロップ、フルアジホップ、ハロキシホップ、ピノキサデン、プロホキシジム、プロパキザホップ、キザロホップ、セトキシジム、テプラロキシジムおよびトランコキシジムが挙げられ、フェノキサプロップ - P、フルアジホップ - P、ハロキシホップ - P およびキザロホップ - P などの分割形態、ならびに、クロジナホップ - プロパルギル、シハロホップ - ブチル、ジクロホップ - メチルおよびフェノキサプロップ - P - エチルなどのエステル形態が含まれる。注目すべきは、ピノキサデンもしくはキザロホップと混合された本発明の化合物である。
10

【 0 1 4 0 】

オーキシンは、多くの植物組織における成長を調節する植物ホルモンである。「オーキシン模倣体」(b 4)は、植物成長ホルモンであるオーキシンを模倣し、そこで成長を制御不能および無秩序にし、感受性の種において植物を死に至らせる化学化合物である。オーキシン模倣体の例としては、アミノシクロピラクロル(6 - アミノ - 5 - クロロ - 2 - シクロプロビル - 4 - ピリミジンカルボン酸)およびそのメチル、エチルエステルならびにそのナトリウムおよびカリウム塩、アミノピラリド、ベナゾリン - エチル、クロラムベン、クラシホス、クロメプロップ、クロピラリド、ジカンバ、2 , 4 - D、2 , 4 - DB 20 、ジクロルプロップ、フルロキシピル、ハラウキシフェン(4 - アミノ - 3 - クロロ - 6 - (4 - クロロ - 2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) - 2 - ピリジンカルボン酸)、ハラウキシフェン - メチル(メチル 4 - アミノ - 3 - クロロ - 6 - (4 - クロロ - 2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) - 2 - ピリジンカルボキシレート)、M C P A、M C P B、メコプロップ、ピクロラム、キンクロラック、キンメラック、2 , 3 , 6 - T B A、トリクロビルおよびメチル 4 - アミノ - 3 - クロロ - 6 - (4 - クロロ - 2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) - 5 - フルオロ - 2 - ピリジンカルボキシレートが挙げられる。注目すべきは、ジカンバと混合された本発明の化合物である。

【 0 1 4 1 】

「 E P S P シンターゼ阻害剤」(b 5)は、例えばチロシン、トリプトファンおよびフェニルアラニンなどの芳香族アミノ酸の合成に関する酵素である 5 - エノール - ピルビルシキミ酸 - 3 - リン酸シンターゼを阻害する化学化合物である。E P S P 阻害剤除草剤は、植物群葉を介して容易に吸収され、師部から成長点に移動させられる。グリホサートは、この群に属する比較的非選択的な発芽後除草剤である。グリホサートには、例えばアンモニウム、イソプロピルアンモニウム、カリウム、ナトリウム(セスキナトリウムを含む)およびトリメシウム(代替名: スルホサート)などのエステルおよび塩が含まれる。
30

【 0 1 4 2 】

光化学系 I 電子ダイバーター」(b 6)は、光化学系 I から電子を受容し、数サイクル後にヒドロキシリラジカルを生成する化学化合物である。これらのラジカルは極めて反応性であり、膜脂肪酸およびクロロフィルを含む不飽和脂質を容易に破壊する。これは細胞膜の完全性を破壊するので、細胞および細胞小器官が「漏出」し、葉の急速なしおれや乾燥をもたらし、最終的には植物の死を生じさせる。この第 2 タイプの光合成阻害剤の例としては、ダイコートおよびパラコートが挙げられる。
40

【 0 1 4 3 】

「 P P O 阻害剤」(b 7)は、酵素であるプロトポルフィリノーゲンオキシダーゼを阻害して、植物中において細胞膜を破壊し、細胞液の漏出を引き起こす高い反応性の化合物の形成を急速に生じさせる化学化合物である。P P O 阻害剤の例としては、アシフルオルフェン - ナトリウム、アザフェニジン、ベンズフェンジゾン、ビフェノックス、ブタフェナシル、カルフェントラゾン、カルフェントラゾン - エチル、クロメトキシフェン、シニドン - エチル、フルアゾレート、フルフェンピル - エチル、フルミクロラック - ペンチル
50

、フルミオキサジン、フルオログリコフェン - エチル、フルチアセット - メチル、ホメサフェン、ハロサフェン、ラクトフェン、オキサジアルギル、オキサジアゾン、オキシフルオルフェン、ペントキサゾン、プロフルアゾール、ピラクロニル、ピラフルフェン - エチル、サフルフェナシル、スルフェントラゾン、チジアジミン、トリフルジモキサジン（ジヒドロ - 1 , 5 - ジメチル - 6 - チオキソ - 3 - [2 , 2 , 7 - トリフルオロ - 3 , 4 - デヒドロ - 3 - オキソ - 4 - (2 - プロピン - 1 - イル) - 2 H - 1 , 4 - ベンゾキサジン - 6 - イル] - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン）およびチアフェナシル（メチル N - [2 - [[2 - クロロ - 5 - [3 , 6 - デヒドロ - 3 - メチル - 2 , 6 - ジオキソ - 4 - (トリフルオロメチル) - 1 (2 H) - ピリミジニル] - 4 - フルオロフェニル] チオ] - 1 - オキソプロピル] - - アラニネート）が挙げられる。 10

【 0 1 4 4 】

「 G S 阻害剤」（ b 8 ）は、植物がアンモニアをグルタミンへ転換するために用いるグルタミンシンテターゼ酵素の活性を阻害する化学化合物である。結果として、アンモニアが蓄積し、グルタミンレベルが低下する。植物の損傷は、おそらくアンモニアの毒性と他の代謝プロセスに必要とされるアミノ酸の欠乏との複合効果により生じる。 G S 阻害剤としては、例えばグルホシネート - アンモニウムなどのグルホシネートおよびそのエステルおよび塩ならびに他のホスフィノトリシン誘導体、グルホシネート - P ((2 S) - 2 - アミノ - 4 - (ヒドロキシメチルホスフィニル) ブタン酸) およびビラナホスが含まれる。

【 0 1 4 5 】

「 V L C F A エロンガーゼ阻害剤」（ b 9 ）は、エロンガーゼを阻害する多種多様な化学構造を有する除草剤である。エロンガーゼは、 V L C F A の生合成に関与する葉緑体中またはその付近に位置する酵素の 1 種である。植物中において、超長鎖脂肪酸は、葉の表面での乾燥を防止し、花粉粒に安定性をもたらす疎水性ポリマーの主成分である。そのような除草剤には、アセトクロール、アラクロール、アニロホス、ブタクロール、カフェンストロール、ジメタクロール、ジメテナミド、ジフェナミド、フェノキサスルホン (3 - [[(2 , 5 - デクロロ - 4 - エトキシフェニル) メチル] スルホニル] - 4 , 5 - デヒドロ - 5 , 5 - デメチルイソオキサゾール) 、フェントラザミド、フルフェナセット、インダノファン、メフェナセット、メタザクロール、メトラクロール、ナプロアニリド、ナプロパミド、ナプロパミド - M ((2 R) - N , N - デエチル - 2 - (1 - ナフタレニルオキシ) プロパンアミド) 、ペトキサミド、ピペロホス、プレチラクロール、プロパクロール、プロピソクロール、ピロキサスルホンおよびテニルクロールが挙げられ、例えば S - メトラクロールおよびクロロアセトアミドおよびオキシアセトアミドなどの分割形態が含まれる。注目すべきは、フルフェナセットと混合された本発明の化合物である。 30

【 0 1 4 6 】

「オーキシン輸送阻害剤」（ b 10 ）は、オーキシン担体タンパク質と結合することなどによって、植物中におけるオーキシン輸送を阻害する化学物質である。オーキシン輸送阻害剤の例としては、ジフルフェンゾピル、ナプタラム (N - (1 - ナフチル) - フタルアミド酸および 2 - [(1 - ナフタレニルアミノ) カルボニル] 安息香酸としても公知である）が挙げられる。 40

【 0 1 4 7 】

「 P D S 阻害剤」（ b 11 ）は、フィトエンデサチュラーゼ工程でのカロチノイド生合成経路を阻害する化学化合物である。 P D S 阻害剤の例としては、ベフルブタミド、ジフルヘニカン、フルリドン、フルロクロリドン、フルルタモンノルフルルゾンおよびピコリナフェンが挙げられる。

【 0 1 4 8 】

「 H P P D 阻害剤」（ b 12 ）は、 4 - ヒドロキシフェニル - ピルビン酸ジオキシゲナーゼの合成の生合成を阻害する化学物質である。 H P P D 阻害剤の例としては、ベンゾビシクロン、ベンゾフェナップ、ビシクロピロン (4 - ヒドロキシ - 3 - [[2 - [(2 - メトキシエトキシ) メチル] - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジニル] カルボニ 50

ル] ピシクロ [3 . 2 . 1] オクタ - 3 - エン - 2 - オン) 、 フエンキノトリオン (2 - [[8 - クロロ - 3 , 4 - ジヒドロ - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - オキソ - 2 - キノキサリニル] カルボニル] - 1 , 3 - シクロヘキサンジオン) 、 イソキサクロルトル、 イソキサフルトル、 メソトリオン、 ピラスルホトール、 ピラゾリネート、 ピラゾキシフェン、 スルコトリオン、 テフリルトリオン、 テンボトリオン、 トルピラレート (1 - [[1 - エチル - 4 - [3 - (2 - メトキシエトキシ) - 2 - メチル - 4 - (メチルスルホニル) ベンゾイル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] オキシ] エチルメチルカーボネート) 、 トプラメゾン、 5 - クロロ - 3 - [(2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル) カルボニル] - 1 - (4 - メトキシフェニル) - 2 (1 H) - キノキサリノン、 4 - (2 , 6 - ジエチル - 4 - メチルフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 - ジメチル - 3 (2 H) - ピリダジノン、 4 - (4 - フルオロフェニル) - 6 - [(2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル) カルボニル] - 2 - メチル - 1 , 2 , 4 - トリアジン - 3 , 5 (2 H , 4 H) - ジオン、 5 - [(2 - ヒドロキシ - 6 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル) カルボニル] - 2 - (3 - メトキシフェニル) - 3 - (3 - メトキシプロピル) - 4 (3 H) - ピリミジノン、 2 - メチル - N - (4 - メチル - 1 , 2 , 5 - オキサジアゾール - 3 - イル) - 3 - (メチルスルフィニル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミドおよび 2 - メチル - 3 - (メチルスルホニル) - N - (1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンズアミドが挙げられる。注目すべきは、 メソトリオンもしくはピラスルファトールと混合された本発明の化合物である。

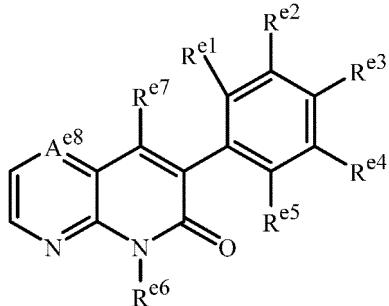
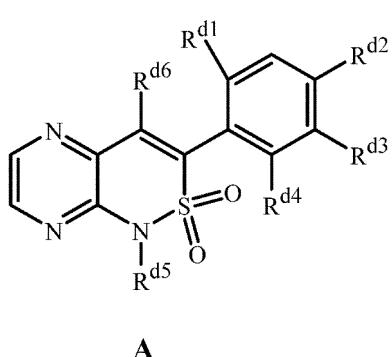
[0 1 4 9]

「HST阻害剤」(b13)は、ホモゲンチジン酸塩を2-メチル-6-ソラニル-1,4-ベンゾキノンに転換する植物の能力を攪乱し、これによってカロチノイド生合成を攪乱する。HST阻害剤の例としては、ハロキシジン、シクロピリモレート(6-クロロ-3-(2-シクロプロピル-6-メチルフェノキシ)-4-ピリダジニル4-モルホリカルボキシレート)、3-(2-クロロ-3,6-ジフルオロフェニル)-4-ヒドロキシ-1-メチル-1,5-ナフチリジン-2(1H)-オン、7-(3,5-ジクロロ-4-ピリジニル)-5-(2,2-ジフルオロエチル)-8-ヒドロキシピリド[2,3-b]ピラジン-6(5H)-オンおよび4-(2,6-ジエチル-4-メチルフェニル)-5-ヒドロキシ-2,6-ジメチル-3(2H)-ピリダジノンが挙げられる。

【 0 1 5 0 】

HST阻害剤にはさらに、式AおよびB：

【化 9】



(式中、 R^{d-1} は H、C 1 もしくは CF_3 であり； R^{d-2} は H、C 1 もしくは Br であり； R^{d-3} は H もしくは C 1 であり； R^{d-4} は H、C 1 もしくは CF_3 であり； R^{d-5} は C H_3 、 CH_2CH_3 もしくは CH_2CHF_2 であり；および、 R^{d-6} は OH もしくは -O $C(=O)-i-Pr$ であり；および、 R^{e-1} は H、F、C 1、 CH_3 もしくは $CH_2C H_3$ であり； R^{e-2} は H もしくは CF_3 であり； R^{e-3} は H、 CH_3 もしくは CH_2CH) 50

R^e_3 であり； R^e_4 は H、F もしくは Br であり； R^e_5 は Cl、CH₃、CF₃、OCF₃ もしくは CH₂CH₃ であり； R^e_6 は H、CH₃、CH₂CHF₂ もしくは C—CH であり； R^e_7 は OH、-OC(=O)Et、-OC(=O)-i-Pr もしくは -OC(=O)-t-Bu であり； および A^e₈ は N もしくは CH である）の化合物が含まれる。

【0151】

「セルロース生合成阻害剤」（b14）は、所定の植物におけるセルロースの生合成を阻害する。それらは、幼植物または急速に成長する植物に発芽前または発芽後早期に適用した場合に最も効果的である。セルロース生合成阻害剤の例としては、クロルチアミド、ジクロベニル、フルボキサム、インダジフラム（N²-[（1R,2S）-2,3-ジヒドロ-2,6-ジメチル-1H-インデン-1-イル]-6-（1-フルオロエチル）-1,3,5-トリアジン-2,4-ジアミン）、イソキサベンおよびトリアジフラムが挙げられる。

【0152】

「他の除草剤」（b15）には、有糸分裂攪乱物質（例えば、フラムプロップ-M-メチルおよびフラムプロップ-M-イソプロピル）、有機ヒ素（例えば、DSMA およびMSMA）、7,8-ジヒドロプロテロイン酸シンターゼ阻害剤、葉緑体イソプレノイド合成阻害剤および細胞壁生合成阻害剤などの多様に異なる作用形態を介して作用する除草剤が含まれる。他の除草剤としては、未知の作用形態を有するか、または、（b1）～（b14）に列挙した特定のカテゴリーのいずれにも属さないか、または、上記に列挙した作用形態の組み合わせを介して作用する除草剤が挙げられる。他の除草剤の例としては、アクロニフェン、アスラム、アミトロール、プロモブチド、シンメチリン、クロマゾン、クミルロン、ダイムロン（daimuron）、ジフェンゾコート、エトベンザニド、フルオメツロン、フルレノール、ホサミン、ホサミン-アンモニウム、ダゾメット、ダイムロン（dymron）、イプフェンカルバゾン（1-（2,4-ジクロロフェニル）-N-（2,4-ジフルオロフェニル）-1,5-ジヒドロ-N-（1-メチルエチル）-5-オキソ-4H-1,2,4-トリアゾール-4-カルボキサミド）、メタム、メチルダイムロン、オレイン酸、オキサジクロメホン、ペラルゴン酸、ピリブチカルブおよび5-[（2,6-ジフルオロフェニル）メトキシ]メチル]-4,5-ジヒドロ-5-メチル-3-（3-メチル-2-チエニル）イソオキサゾールが挙げられる。

【0153】

「除草剤毒性緩和剤」（b16）は、所定の作物に対する除草剤の植物毒性効果を排除または低減するために除草剤配合物に加えられる物質である。これらの化合物は、除草剤による被害から作物を保護するが、典型的には除草剤による望ましくない植生の防除を妨げない。除草剤毒性緩和剤の例としては、これらに限定されないが、ベノキサコール、クロキントセット-メキシル、クミルロン、シオメトリニル、シプロスルファミド、ダイムロン、ジクロルミド、ジシクロノン、ジエトレート、ジメピペレート、フェンクロラゾール-エチル、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン-エチル、メフェンピル-ジエチル、メフェネート、メトキシフェノン、ナフトタル酸無水物、オキサベトリニル、N-（アミノカルボニル）-2-メチルベンゼンスルホンアミドおよびN-（アミノカルボニル）-2-フルオロベンゼンスルホンアミド、1-プロモ-4-[（クロロメチル）スルホニル]-ベンゼン、2-（ジクロロメチル）-2-メチル-1,3-ジオキソラン（MG191）、4-（ジクロロアセチル）-1-オキサ-4-アゾスピロ[4.5]デカン（MON4660）、2,2-ジクロロ-1-（2,2,5-トリメチル-3-オキサゾリジニル）-エタノンならびに2-メトキシ-N-[[4-[[（メチルアミノ）カルボニル]アミノ]フェニル]スルホニル]-ベンズアミドが挙げられる。

【0154】

式1の化合物は、合成有機化学の技術分野において公知である一般的方法によって調製することができる。スキーム1～19に記載した下記の方法および変形の1つ以上は、式

10

20

30

40

50

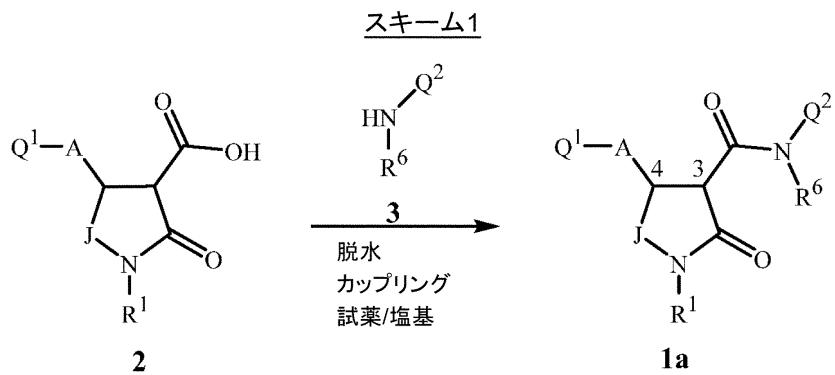
1の化合物を調製するために使用できる。下記の式1～19の化合物中のR¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、Q¹、Q²、J、A、Y¹およびY²の定義は、他に明記されていない限り、発明の概要において上記に定義したとおりである。式1a、1b、1aa、1ab、1ba、1bb、1c、1d、1e、1f、1g、1g'、1h、2'、4a、4b、5a、5b、5c、5d、5a'、5b'、7a、7b、8a、8b、10aおよび10bの化合物は、式1、2、4、5、7、8および10それぞれの化合物の様々なサブセットである。

【 0 1 5 5 】

スキーム 1 に示したように、式 1 a (すなわち、式中、 R¹ 、 R⁴ および R⁵ が H であり、ならびに Y¹ および Y² が O である式 1) の化合物は、プロピルホスホン酸無水物、ジシクロヘキシルカルボジイミド、 N - (3 - ジメチルアミノプロピル) - N' - エチルカルボジイミド、 N , N' - カルボニルジイミダゾール、 2 - クロロ - 1 , 3 - ジメチルイミダゾリウムクロリドまたは 2 - クロロ - 1 - メチルピリジニウムヨージドなどの脱水カップリング試薬の存在下における式 2 の酸と式 3 のアミンとの反応によって調製することができる。例えばポリマー担持ジクロヘキシルカルボジイミドなどのポリマー担持試薬もまた好適である。これらの反応は、典型的には 0 ~ 60 °C の範囲の温度、ジクロロメタン、アセトニトリル、 N , N - ジメチルホルムアミドまたは酢酸エチルなどの溶媒中で、トリエチルアミン、 N , N - ジイソプロピルアミンもしくは 1 , 8 - ジアザビシクロ [5 . 4 . 0] ウンデカ - 7 - エンなどの塩基の存在下で実施される。プロピルホスホン酸無水物を使用するカップリング条件については、Organic Process Research & Development 2009, 13, 900 - 906 を参照されたい。プロピルホスホン酸無水物を利用するスキーム 1 の方法は合成例 1 の工程 E に例示した。スキーム 1 の方法は、合成例 1 の工程 E および合成例 2 の工程 D によって例示した。

【化 1.0】

【化 1 0】

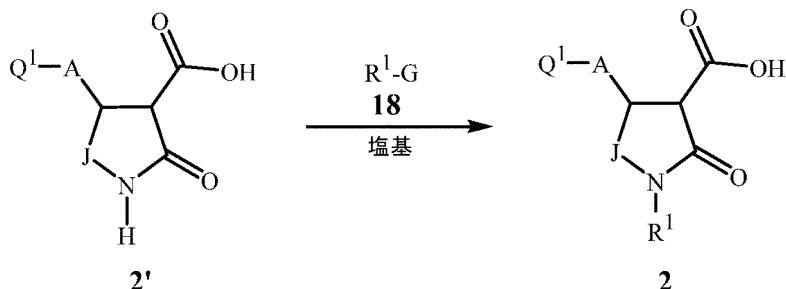


【 0 1 5 6 】

トニトリル、C₂～C₆アルコールおよびアセトンならびにこれらの溶媒の混合物を含むがこれらに限定されない多種多様な溶媒が好適である。この反応は、-20～200、および典型的には0～50の範囲内の温度で実施される。

【化11】

スキーム2



10

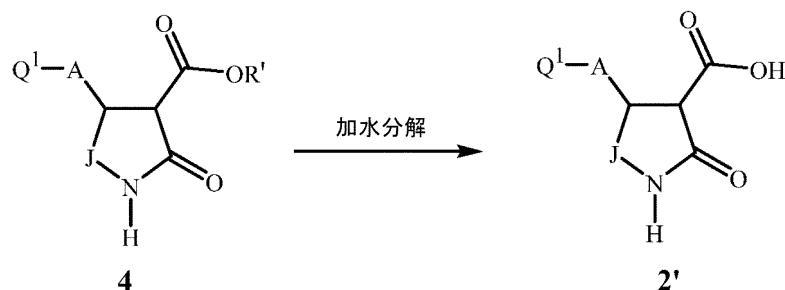
【0157】

スキーム3に示したように、式**2'**の化合物は、式**4**のエステルの加水分解によって調製することができる。加水分解は、水性塩基もしくは水性酸を用いて、典型的には共溶媒の存在下で実施される。この反応のために好適な塩基には、これらに限定されないが、水酸化ナトリウムおよび水酸化カリウムなどの水酸化物ならびに炭酸ナトリウムおよび炭酸カリウムなどの炭酸塩が含まれる。この反応のための好適な酸には、これらに限定されないが、塩酸、臭化水素酸および硫酸などの無機酸ならびに酢酸およびトリフルオロ酢酸などの有機酸が含まれる。この反応のためには、メタノール、エタノールおよびテトラヒドロフランを含むがこれらに限定されない多種多様な共溶媒が好適である。この反応は、-20から溶媒の沸点、および典型的には0～100の範囲内の温度で実施される。スキーム3の方法は、合成例1の工程Dおよび合成例2の工程Dによって例示した。

20

【化12】

スキーム3



30

R'は、低級アルキルである

【0158】

スキーム4に示したように、式**4a**もしくは**4b**の化合物は、式**5a**もしくは**5b**それぞれの化合物の還元およびその後の生じた中間体アミンの*in situ*環化により得ることができる。式**5a**もしくは**5b**の化合物中における脂肪族ニトロ基もしくはニトリル基を還元するための多種多様な方法は、文献において知られている。これらの方法には、酸性培地中のパラジウム炭素もしくはラネーニッケル、鉄もしくは亜鉛金属の（例えば、Berichte der Deutschen Chemischen Gesellschaft 1904, 37, 3520-3525を参照されたい）および水素化アルミニウムリチウムの存在下における触媒水素化が含まれる。脂肪族ニトロ基の還元は、さらにまた例えばメタノールなどのプロトン源の存在下でヨウ化サマリウム（II）を用いて達成することもできる（例えば、Tetrahedron Letters 1991, 32(14), 1699-1702を参照されたい）。または、例えば酢酸ニッケル（II）もしくは塩化ニッケル（II）などのニッケル触媒の存在下で、水素化ホウ素ナ

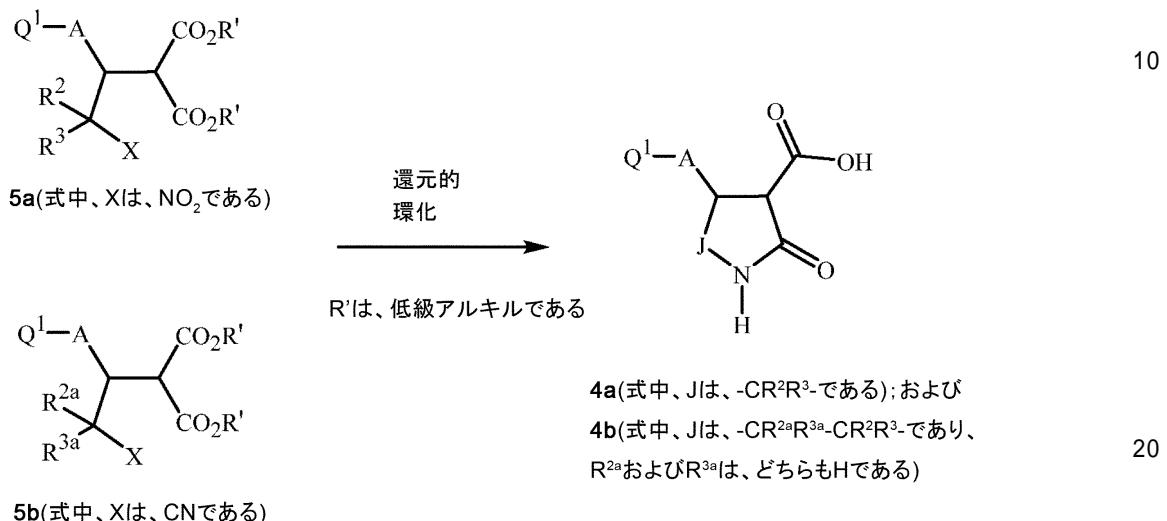
40

50

トリウムもまた使用できる（例えば、*Tetrahedron Letters* 1985, 26 (52), 6413-6416を参照されたい）。酢酸ニッケル（II）の存在下で水素化ホウ素ナトリウムを利用するスキーム4の方法は、合成例1の工程Cによって例示した。塩化アンモニウムの存在下で鉄を利用するスキーム4の方法は、合成例2の工程Cによって例示した。

【化13】

スキーム4

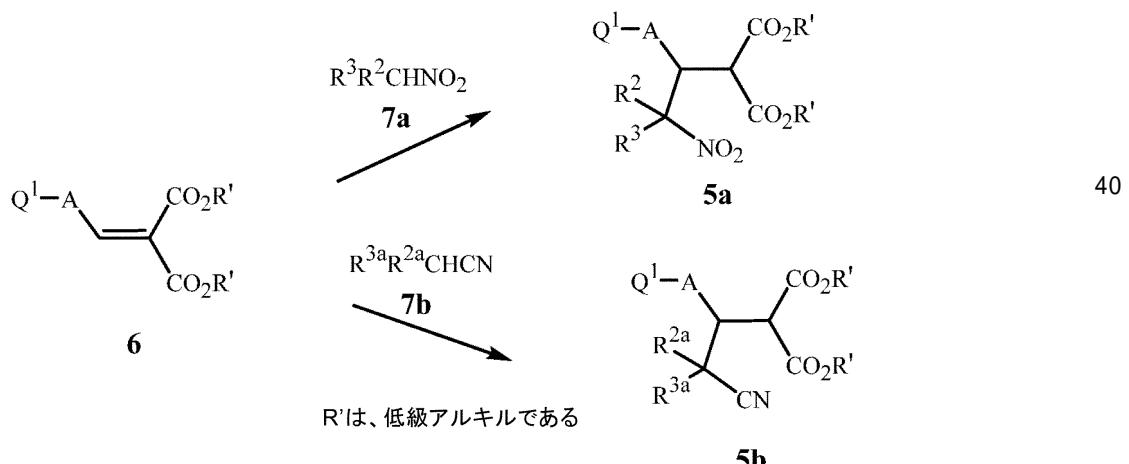


【0159】

スキーム5に示したように、式5aもしくは5bの化合物は、式6のジエステルと式7aのニトロアルカンまたは式7bのニトリルそれぞれとを典型的には塩基の存在下で反応させることにより調製することができる。この反応のために好適な塩基には、例えばメタノール中のナトリウムメトキシドまたはエタノール中のナトリウムエトキシドなどのアルカリ金属低級アルコキシドが含まれる。式6の化合物は、例えばアルデヒドおよびマロネートのクネーベナーゲル縮合のような様々な方法によって容易に調製することができる（例えばG. Jones, *Organic Reactions Volume 15*, John Wiley and Sons, 1967を参照されたい）。

【化14】

スキーム5



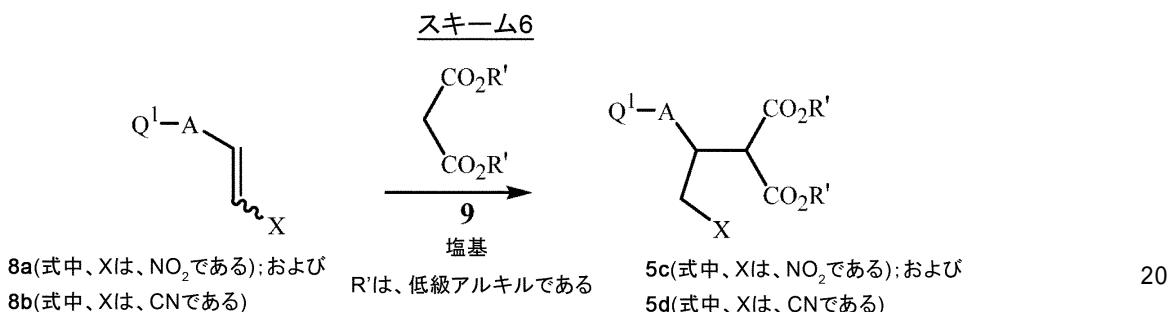
【0160】

式5cもしくは5dの化合物（すなわち、式5aもしくは5b（式中、R²およびR³

50

は、Hである)の化合物)は、スキーム6に示したように、塩基の存在下で、式8aもしくは8bの化合物と式9のマロネートとを反応させることにより調製することができる。この反応のために好適な塩基には、これらに限定されないが、例えばメタノール中のナトリウムメトキシドもしくはエタノール中のナトリウムエトキシドなどのアルカリ金属低級アルコキシドまたは例えばテトラヒドロフランなどの溶媒中のリチウムビス(トリメチルシリル)アミド、ナトリウムビス(トリメチルシリル)アミドおよびリチウムジイソプロピルアミドなどの塩基が含まれる。典型的には、この反応は、例えば、Synthesis 2005, 2239-2245に記載されたような-78~23の範囲内で実施される。この転換を触媒の非存在下の還流水で実施するための条件は、Synthetic Communications 2013, 43, 744-748に報告されている。
10

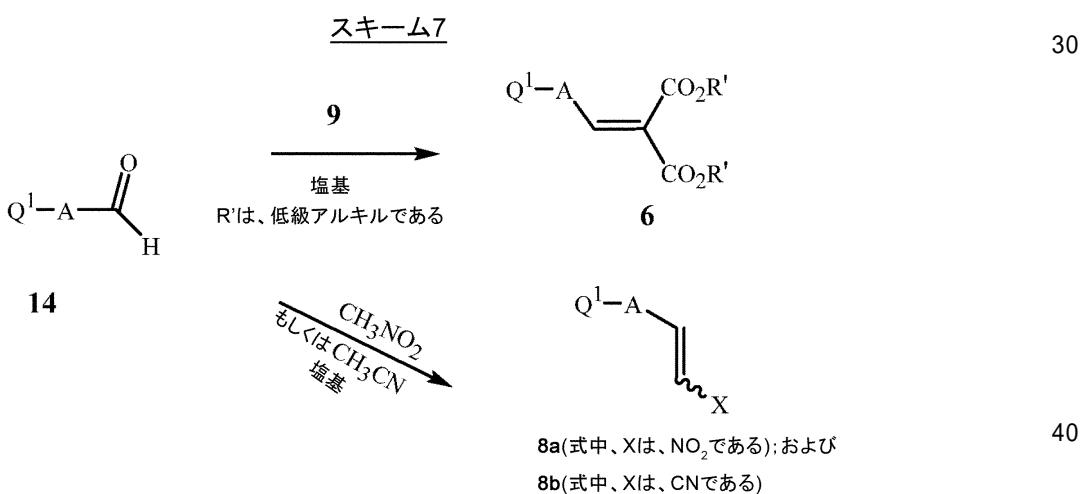
【化15】



【0161】

式6の化合物は、スキーム7に示したように、式14のアルデヒドと式9のマロネートとのクネーベナーゲル縮合によって容易に調製することができる。同様にスキーム7に示したように、式8aおよび8bの化合物は、式14のアルデヒドとニトロメタンもしくはアセトニトリルそれぞれとのクネーベナーゲル縮合によって調製することができる。

【化16】



【0162】

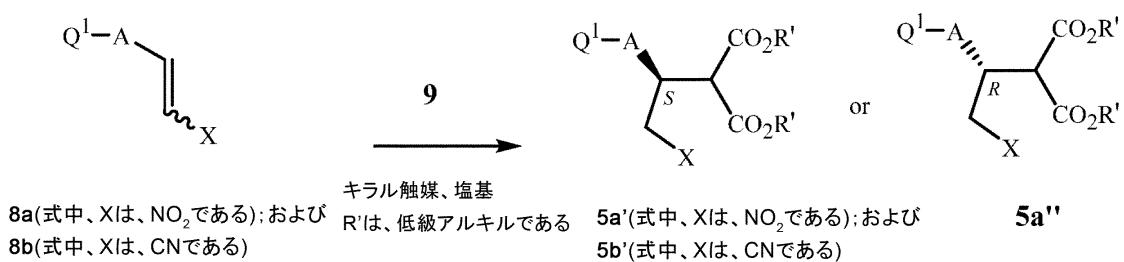
式5a'および5a''の化合物は、スキーム8に示したように、キラル触媒の存在下および任意選択的に好適な塩基の存在下で、式8aのニトロアルケンを式9のマロネートと反応させることによって立体選択的に調製することができる。好適な触媒には、これらに限定されないが、例えばNi(II)ビス[(R,R)-N,N'-ジベンジルシクロヘキサン-1,2-ジアミン]ジプロミド、Ni(II)ビス[(S,S)-N,N'-ジベンジルシクロヘキサン-1,2-ジアミン]ジプロミドなどのビシナルジアミンを含むNi(II)またはキラル1,1'-ビ(テトラヒドロイソキノリン)型ジアミンを含む。
50

む臭化ニッケル(II)が含まれる。この反応のために好適な有機塩基には、これらに限定されないが、ピペリジン、モルホリン、トリエチルアミン、4-メチルモルホリンもしくはN,N-ジイソプロピルエチルアミンが含まれる。この転換は、そのまで、または例えばテトラヒドロフラン、トルエンもしくはジクロロメタンなどの溶媒中で実施することができる。典型的には、この反応は、-78 ~ -80 の範囲内で0~1当量の触媒および任意選択的に0~1当量の塩基を使用して実施される。この転換を実施するための条件は、J. Am. Chem. Soc. 2005, 9958-9959または条件についてのEur. J. Org. Chem. 2011, 5441-5446に報告されている。式8aのニトロアルケンは、当業者には公知の方法によって、アルデヒドおよびニトロメタンから容易に調製することができる。

10

【化17】

スキーム8



20

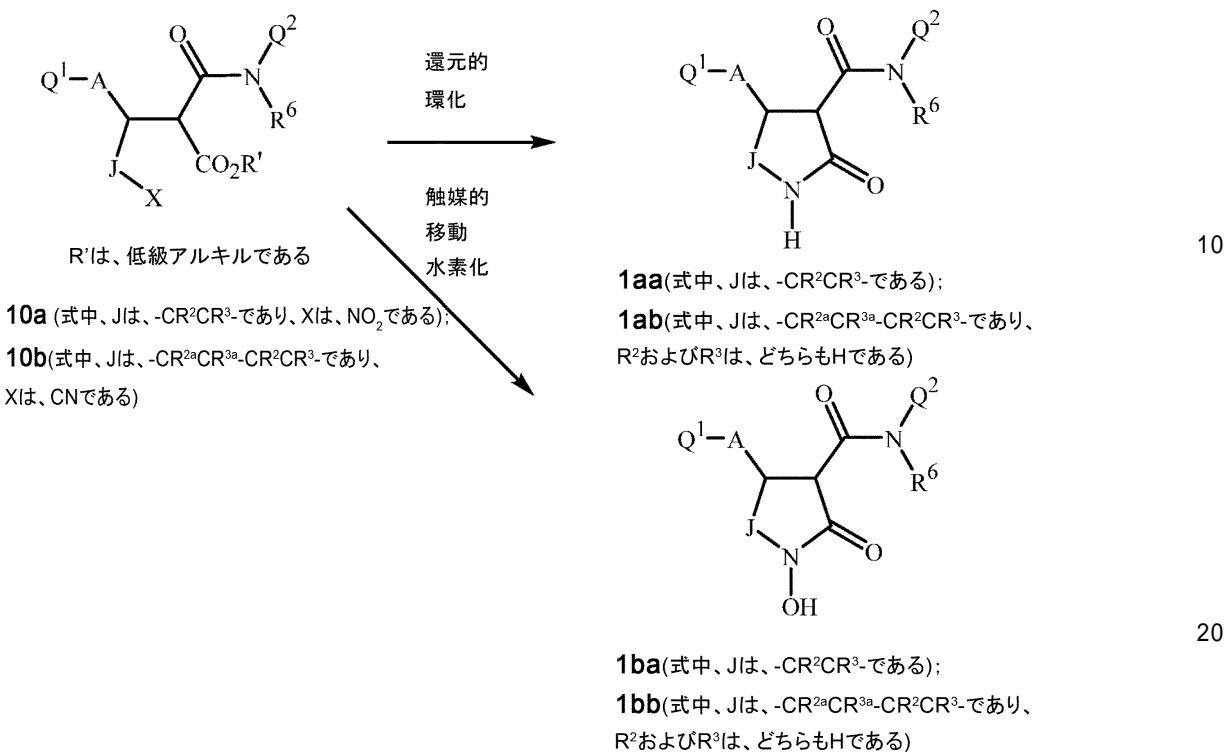
【0163】

スキーム9に示したように、式1a aおよび1a bの化合物は、さらにまたスキーム4の方法に類似して式10aおよび10bの化合物の還元的環化によって調製することができる。同様にスキーム9に示したように、式1b aおよび1b b(すなわち、式中、R¹がOHであり、R⁴およびR⁵がHであり；およびY¹およびY²がOである式1)の化合物は、パラジウム炭素の存在下で、式10aおよび10bの化合物それぞれからギ酸アンモニウムを用いた触媒的移動水素化、およびその後の中間体ヒドロキシリジノンのin situ環化によって調製することができる。N-ヒドロキシピロリジノンを生成するための触媒的移動水素化/環化条件については、J. Med. Chem. 1993, 36, 1041-1047を参照されたい。

30

【化18】

スキーム9

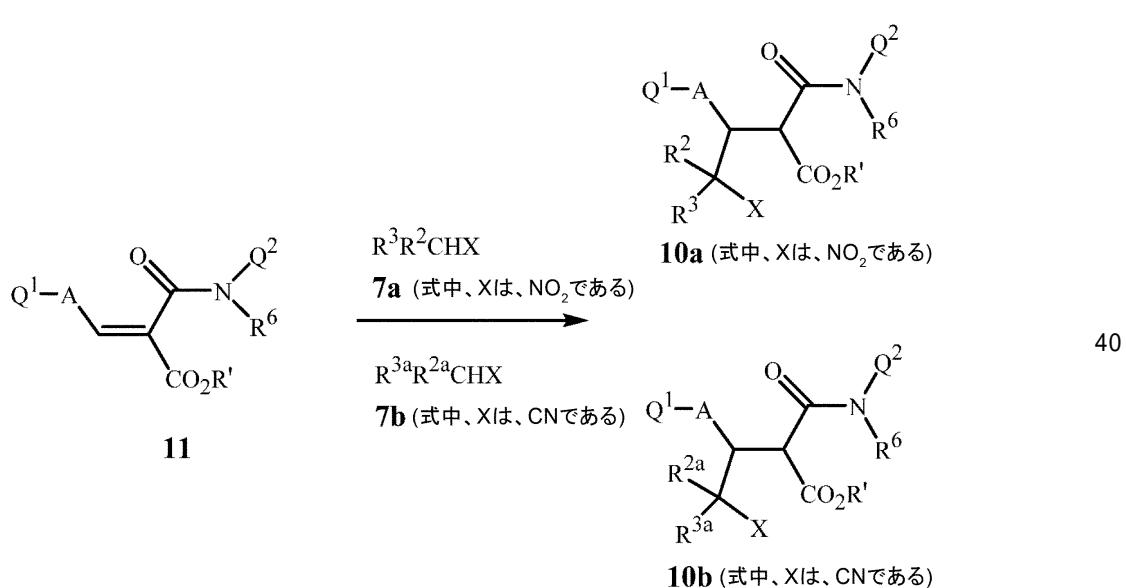


【0164】

スキーム10に示したように、式10aおよび10bの化合物は、スキーム5に記載した方法に類似して塩基の存在下で、式11の化合物を溶媒中のそれぞれ式7aの化合物もしくは式7bの化合物と反応させることによって調製することができる。

【化19】

スキーム10

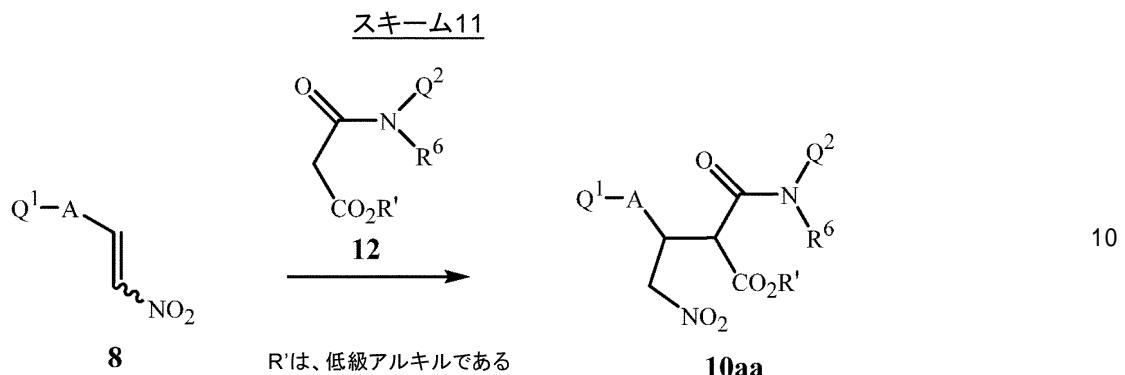


【0165】

スキーム11に示したように、式10aa (すなわち、式中R^{2a}およびR^{3a}がHで)

ある式 10 a) の化合物は、スキーム 6 の方法に類似して、式 8 のニトロアルケンを式 12 のマロネートと反応させることによって調製することができる。

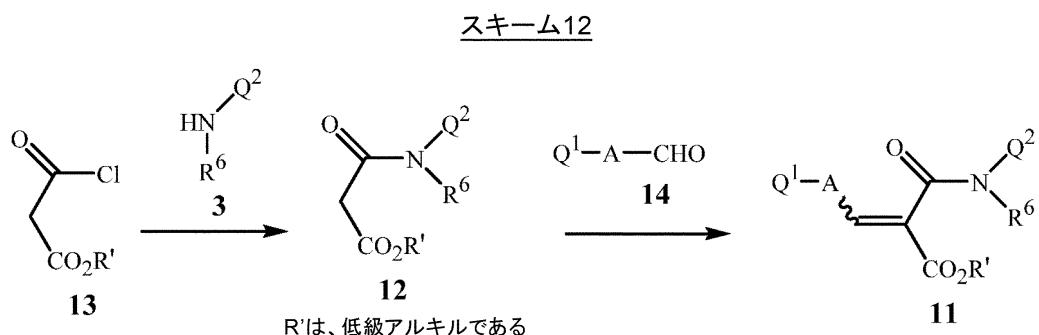
【化 2 0】



【0 1 6 6】

スキーム 12 に示したように、式 11 の化合物は、式 12 のマロン酸アミドを式 14 のアルデヒドと反応させることによって調製することができる。同様にスキーム 12 に示したように、式 12 のマロン酸アミドは、例えば塩化メチルマロニルなどの式 13 の低級アルキル塩化マロニルおよび式 3 のアミンから容易に調製することができる。

【化 2 1】



【0 1 6 7】

スキーム 13 に示したように、式 1 c (すなわち、式中、R¹ および R⁵ が H であり、R⁴ がハロゲンであり、Y¹ および Y² が O である式 1) および式 1 d (すなわち、式中、R¹ および R⁴ が H であり、R⁵ がハロゲンであり、Y¹ および Y² が O である式 1) の化合物の混合物は、開始剤の存在下もしくは非存在下で、溶媒中において式 1 a の化合物をハロゲン源と反応させることによって調製することができる。この反応によって生成される幾何異性体の分離は、例えばクロマトグラフィーもしくは分別結晶化などの標準方法によって達成できる。この反応のために好適なハロゲン源には、臭素、塩素、N - クロロスクシンイミド、N - ブロモスクシンイミドおよび N - ヨードスクシンイミドが含まれる。この反応のために好適な開始剤には、2 , 2 ' - アゾビスイソブチロニトリル (AIBN) および過酸化ベンゾイルが含まれる。典型的には、この反応は、ジクロロメタンなどの溶媒中において 0 ℃ から溶媒の沸点の範囲内で実施される。

10

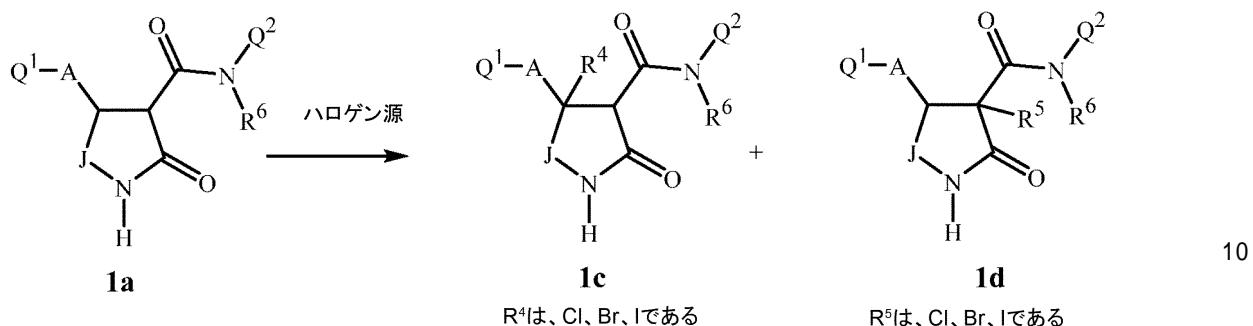
20

30

40

【化22】

スキーム13

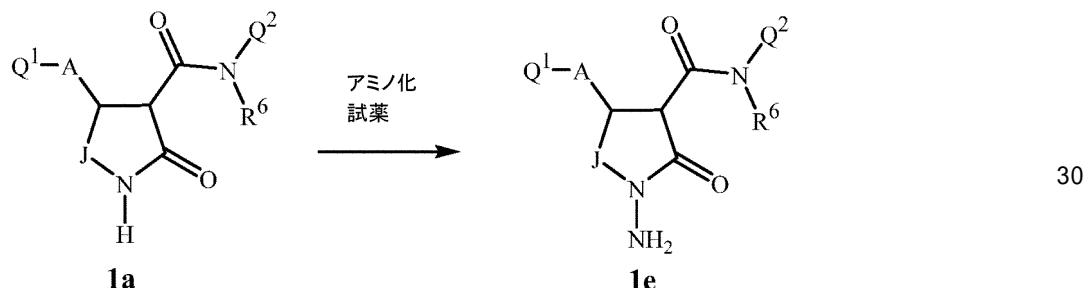


【0168】

スキーム14に示したように、式1e（すなわち、式中、R¹がNH₂であり、R⁴およびR⁵がHであり、Y¹およびY²がOである式1）の化合物は、式1aの化合物を例えればO-（ジフェニルホスフィニル）ヒドロキシリルアミンおよびヒドロキシアミノ-O-スルホン酸などのアミノ化試薬と反応させることによって調製することができる。手法、条件および試薬については、Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters 2009, 19, 5924 - 5926 および Journal of Organic Chemistry 2002, 67, 6236 - 6239 を参照されたい。

【化23】

スキーム14

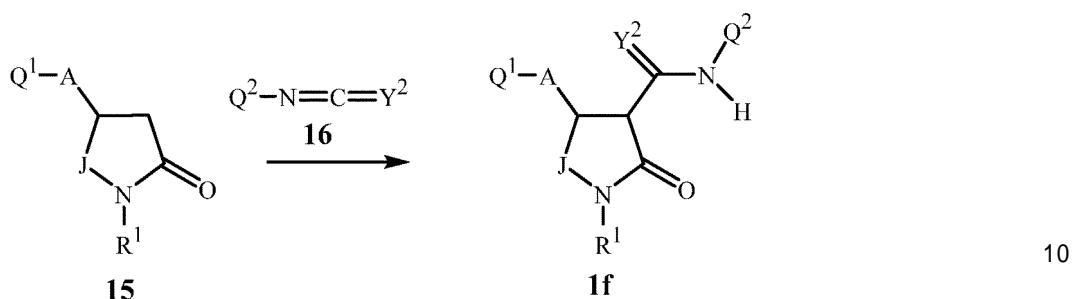


【0169】

スキーム15に示したように、式1f（すなわち、式中、R⁴、R⁵およびR⁶がHであり、Y¹およびY²がOである式1）の化合物は、塩基の存在下で、式15の化合物とイソシアネート（すなわち、式中、Y²がOである式16）もしくはイソチオシアネート（すなわち、式中、Y²がSである式16）との反応によって生成することができる。本工程に使用できる塩基の例としては、スキーム5の方法に列挙した塩基が挙げられる。反応温度は、-78から使用する不活性溶媒の沸点までの範囲から選択することができる。典型的には、この反応は、例えばトルエンなどの溶媒中において-78～100の範囲内の温度で実施される。

【化24】

スキーム15

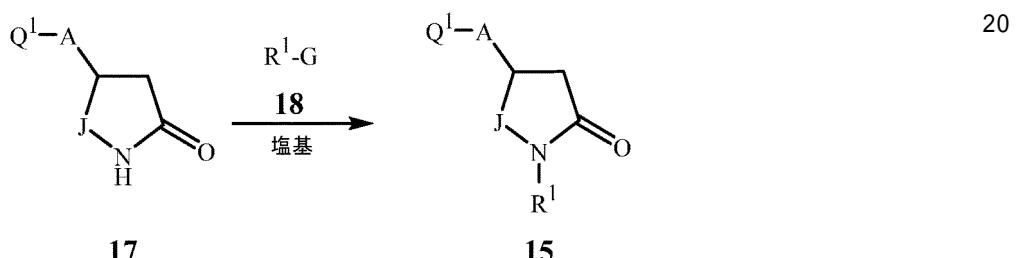


【0170】

スキーム16に示したように、式15の化合物は、スキーム2に記載した方法に類似して、塩基の存在下で、式17の化合物と式18の対応する求電子剤との反応によって調製することができる。

【化25】

スキーム16

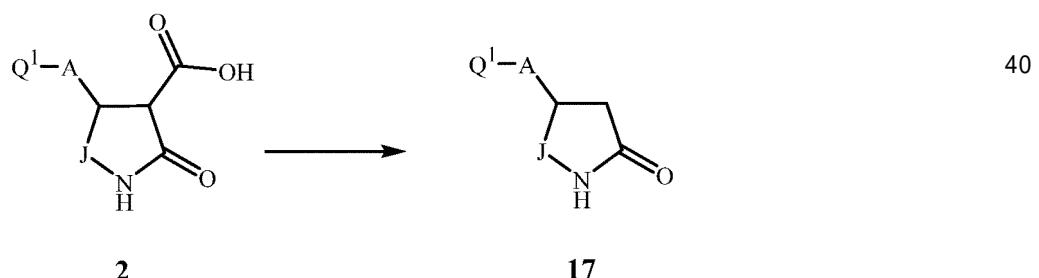


【0171】

スキーム17に示したように、式17の化合物は、式2の酸の脱炭酸化によって調製することができる。脱炭酸化は、典型的には酸の存在下で、溶媒中の式2の化合物を加熱することによって実施される。この反応のために好適な酸には、p-トルエンスルホン酸が含まれるが、それには限定されない。この反応のために、トルエン、酢酸イソプロパノールおよびイソブチルメチルケトンを含む多種多様な共溶媒が好適であるが、これらに限定されない。この反応は、-20から溶媒の沸点、および典型的には0~150の範囲内の温度で実施される。

【化26】

スキーム17



【0172】

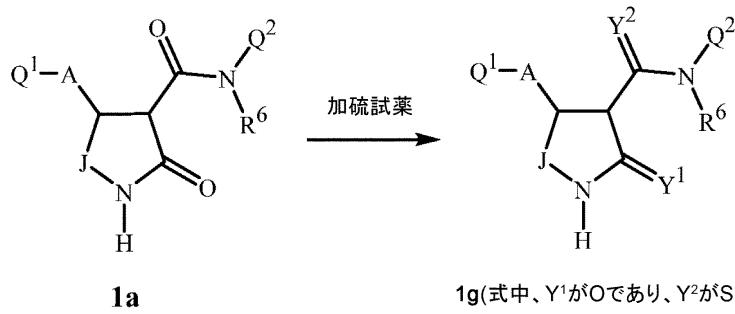
スキーム18に示したように、式1g（すなわち、式中、 R^1 がHであり、 R^4 および R^5 がHであり、 Y^1 および Y^2 がSである式1）の化合物は、例えばテトラヒドロフラランもしくはトルエンなどの溶媒中において、式1aの化合物を例えればローソン試薬、十硫

50

化四リンもしくは五硫化ニリンなどの少なくとも2当量の加硫試薬と反応させることにより調製することができる。典型的には、この反応は、0～115の範囲内の温度で実施される。当業者であれば、2当量未満の加硫試薬を用いると、クロマトグラフィーおよび結晶化などの従来方法によって分離できる、式1gおよび1g'（式中、Y¹がOであり、Y²がSであるか、または、Y¹がSであり、Y²がOである生成物）の化合物を含む混合物を得ることが可能であることを認識している。

【化27】

スキーム18

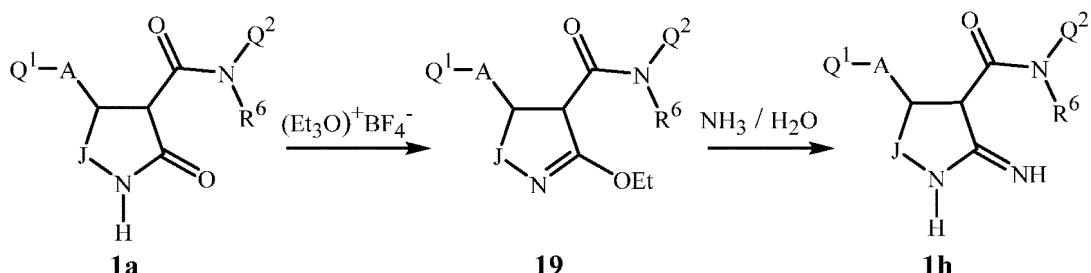


【0173】

スキーム19に示したように、式1h（すなわち、式中、R¹、R⁴、R⁵がHであり、Y²がOであり、Y¹がNHである式1）の化合物は、式1aの化合物であるトリエチルオキソニウムテトラフルオロボレート（メーヤワイン試薬）のアルキル化、およびこの後に、得られた式19のイミノエーテルのアンモニア水による処理によって調製することができる。

【化28】

スキーム19



【0174】

式1の種々の化合物を得るために様々な官能基を他の基に転換させることができることは当業者に認識されている。官能基の単純かつ明快な相互変換を例示する価値ある情報源に関しては、Larock, R. C., Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations, 2nd Ed., Wiley-VCH, New York, 1999を参照されたい。例えば、式1の化合物を調製するための中間体は芳香族ニトロ基を含有することができ、これをアミノ基に還元し、その後に、ザンドマイヤー反応などの当技術分野において周知である反応を介して様々なハロゲン化物に転換して式1の化合物を得ることができる。上記の反応はまた、多くの例において、また別の順序で実施することができる。

【0175】

式1の化合物を調製するための上記のいくつかの試薬および反応条件は、中間体に存在する所定の官能基については適合しない場合があることは認識されている。これらの場合

10

20

30

40

50

には、保護 / 脱保護シーケンスもしくは官能基相互転換を合成に組み込むことで、所望の生成物の入手が促進されるであろう。保護基の使用および選択は、化学合成における当業者には明白であろう（例えば、Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. Protective Groups in Organic Synthesis, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991を参照されたい）。当業者であれば、一部の場合には、任意の個別のスキームに記載されている試薬を導入した後に、式1の化合物の合成を完了するために、詳述されていない追加のルーチン的な合成工程の実施が必要となる場合があることを認識するであろう。当業者であれば、上記のスキームに例示した工程の組み合わせを、式1の化合物を調製するために特に提示したものによって示唆された以外の順序で実施することが必要となる可能性があることを認識するであろう。

10

【0176】

当業者はまた、本明細書に記載される式1の化合物および中間体が、置換基を追加するためにまたは存在する置換基を変更するために、様々な親電子的、求核的、ラジカル、有機金属、酸化および還元反応にかけることができるることを認めるであろう。

【0177】

さらなる入念な検討なしに、先行記載を用いる当業者は、最大程度に本発明を利用することができると考えられる。以下の非限定的な例は、本発明の例示である。以下の実施例における工程は、合成変換全体における各工程についての手法を例示するものであり、各工程のための出発材料は、必ずしも、その手法が他の実施例または工程において記載されている特定の調製作業によって調製されていなくてもよい。パーセンテージは、クロマトグラフィー溶媒混合物または他に明記した場合を除いて、重量%である。クロマトグラフィー溶媒混合物についての部およびパーセンテージは、他に規定しない限り、体積部および体積%である。¹H NMRスペクトルは、テトラメチルシランの低磁場側のppmで報告されており；「s」は一重項を意味し、および「d」は二重項を意味する。質量スペクトル(MS)は、「amu」が統一原子質量単位を表す任意の大気圧下学イオン化(AP+)を使用して質量分析計に結合された液体クロマトグラフィー(LCMS)を使用することによって観察される、分子へのH+(分子量1)の付加によって形成される最高同位体存在度親イオン(M+1)または分子からのH+(分子量1)の消失によって形成される(M-1)の分子量であると報告される。

20

【実施例】

30

【0178】

合成例1

N-(2,3-ジフルオロフェニル)-4-[(4-フルオロフェニル)メチル]-2-オキソ-3-ピロリジンカルボキサミド(化合物13)の調製

工程A：1,3-ジエチル2-[2-(4-フルオロフェニル)エチリデン]プロパンジオエートの調製

四塩化チタン(14.5mL、14.5mmol、塩化メチレン中で1M)を20mLのテトラヒドロフラン中に滴下し、-1.5に冷却した。滴下中の温度は、3.5未満に維持した。生じた黄色懸濁液は、内部温度を3未満に維持しながら、25mLの無水テトラヒドロフラン中の4-フルオロフェニルアルデヒド(4g、29.0mmol)およびマロン酸ジエチル(4.6g、29.0mmol)と結合した。この時点に、この溶液に無水ピリジン(9.2mL、115.8mmol)を加え、これを内部温度を-3~0に維持しながら1時間攪拌し、次にこの混合物を16時間かけて周囲温度に加温するに任せた。この反応混合物を水で希釈し、エーテルで抽出した。結合有機抽出物を水、0.5NのHCl水溶液、水、飽和NaHCO₃水溶液、飽和NaCl水溶液で連続的に洗浄し、最後にNa₂SO₄の上方に通して乾燥させた。粗物質は、石油エーテル中の30%酢酸エチルを用いて溶出させるシリカゲル(60~120メッシュ)カラムクロマトグラフィーにかけると、4.0gの標題化合物の粗生成物が得られたので、これを特性解析またはそれ以上の精製を行わずに工程Bに運んだ。

40

【0179】

50

工程 B : 1 , 3 - ジエチル 2 - [1 - (4 - フルオロフェニル) メチル - 2 - ニトロエチル] プロパンジオエートの調製

エタノール (40 mL) 中の 1 , 3 - ジエチル 2 - [2 - (4 - フルオロフェニル) エチリデン] プロパンジオエート (すなわち、工程 A の生成物、 4 g, 14.3 mmol) の溶液にニトロメタン (8.7 g, 142.7 mmol) およびナトリウムエトキシド (0.388 g, 1.4 mmol, エタノール中の 25 重量 %) を加え、この反応混合物を室温で 16 時間にわたり攪拌した。反応混合物を酢酸エチルで希釈し、水および塩水溶液で洗浄した。有機相を分離し、 Na_2SO_4 の上方に通して乾燥させ、 in vacuo で濃縮した。粗物質は、石油エーテル中の 30 % 酢酸エチルを用いて溶出させるシリカゲル (60 ~ 120 メッシュ) カラムクロマトグラフィーにかけると、 5.0 g の標題化合物の粗生成物が得られたので、これを特性解析またはそれ以上の精製を行わずに工程 C に運んだ。

【 0180 】

工程 C : エチル 4 - [(4 - フルオロフェニル) - 2 - オキソ - 3 - ピロリジンカルボキシレートの調製

エタノール (50 mL) 中の 1 , 3 - ジエチル 2 - [1 - (4 - フルオロフェニル) メチル - 2 - ニトロフェニル] プロパンジオエート (すなわち、工程 B の生成物、 5.0 g, 14.7 mmol) の溶液に $\text{NiAc}_2 \cdot 4\text{H}_2\text{O}$ (18.2 g, 73.2 mmol) を加えた。この溶液を 0 に冷却し、 NaBH_4 (2.7 g, 73.2 mmol) を少しずつ加えた。この溶液を周囲温度へ加温するに任せ、 16 時間にわたり攪拌した。この反応混合物を Celite (登録商標) 珪藻土濾過助剤に通して濾過した。濾液を酢酸エチルで希釈し、水および塩水溶液で洗浄した。有機相を分離し、次に Na_2SO_4 の上方に通して乾燥させ、 in vacuo で濃縮した。粗物質は、石油エーテル中の 60 % の酢酸エチルを用いて溶出させるシリカゲル (60 ~ 120 メッシュ) カラムクロマトグラフィーにかけると、固体 (0.85 g) として標題化合物が得られた。

MS : [M + 1] 266.0 .

【 0181 】

工程 D : 4 - [(4 - フルオロフェニル) メチル] - 2 - オキソ - 3 - ピロリジンカルボン酸の調製

10 のエタノール (10 mL) 中のエチル 4 - [(4 - フルオロフェニル) メチル] - 2 - オキソ - 3 - ピロリジンカルボキシレート (すなわち、工程 C の生成物、 0.8 g, 3.0 mmol) の溶液に水酸化ナトリウム (0.362 g, 50 重量 % 水溶液) を加えた。この溶液を 16 時間にわたり攪拌し、周囲温度に加温するに任せた。反応塊を酢酸エチルで希釈し、 1 N の HCl 水溶液、水および塩水溶液で洗浄した。有機相を分離し、次に Na_2SO_4 の上方に通して乾燥させ、 in vacuo で濃縮した。粗物質をジエチルエーテルおよびペンタンによりすり潰す (tritrationg) ことによって精製すると固体 (0.5 g) として標題化合物が得られた。

MS : [M - 1] 236.0 .

【 0182 】

工程 E : N - (2 , 3 - ジフルオロフェニル) - 4 - [(4 - フルオロフェニル) メチル] - 2 - オキソ - 3 - ピロリジンカルボキサミドの調製

塩化メチレン (2 mL) 中の 4 - [(4 - フルオロフェニル) メチル] - 2 - オキソ - 3 - ピロリジンカルボン酸 (すなわち、工程 D の生成物、 0.2 g, 0.84 mmol) の溶液にトリエチルアミン (0.255 g, 2.5 mmol) および 2 , 3 - ジフルオロアナリン (difluoroaniline) (0.120 g, 0.93 mmol) 、および次にプロピルホスホン酸無水物 (0.456 g, 1.4 mmol) を加えた。この溶液を 16 時間攪拌し、次に酢酸エチルで希釈し、水および塩水溶液で洗浄した。有機相を分離し、次に Na_2SO_4 の上方に通して乾燥させ、 in vacuo で濃縮した。粗物質をジエチルエーテルおよびペンタンによりすり潰す (tritrationg) ことによつて精製するとオフホワイトの固体 (0.18 g) として標題化合物が得られた。

10

20

30

40

50

M S : [M - 1] 2 3 6 . 0 および M P 1 7 3 ~ 1 7 6 ;

¹ H N M R (D M S O - d ₆ , 3 0 0 M H z) 1 0 . 0 6 (s , 1 H) , 7 . 9 7 (s , 1 H) , 7 . 6 1 - 7 . 6 4 (m , 1 H) , 7 . 0 1 - 7 . 2 8 (m , 6 H) , 3 . 4 5 - 3 . 4 8 (m , 1 H) , 3 . 2 5 - 3 . 2 7 (m , 1 H) , 2 . 9 5 - 3 . 0 8 (m , 2 H) , 2 . 7 9 - 2 . 8 1 (m , 2 H) .

【 0 1 8 3 】

合成例 2

N - (2 , 3 - ジフルオロフェニル) - 2 - オキソ - 4 - [(1 E) - 2 - フェニルエテニル] - 3 - ピロリジンカルボキサミド (化合物 3 3) の調製

工程 A : 1 , 3 - ジエチル 2 - [(2 E) - 3 - フェニル - 2 - プロペン - 1 - イリデン] プロパンジオエートの調製 10

トルエン (3 0 m L) 中の (2 E) - 3 - フェニル - 2 - プロペナール (5 . 0 g , 37 . 8 3 m m o l) 、マロン酸ジエチル (6 . 0 5 g , 37 . 8 3 m m o l) およびピペリジン (0 . 6 4 g , 7 . 5 7 m m o l) の溶液に酢酸 (0 . 4 3 m L) を加えた。この反応混合物を共沸蒸留によって水を除去するために、ディーンスタークトラップ下で 3 時間にわたり還流させた。反応の進行は、薄層クロマトグラフィー分析によって監視した。完了後、反応混合物を水 (2 5 m L) 中に注入し、酢酸エチル (3 × 2 5 m L) で抽出した。結合有機相を水 (2 5 m L) で洗浄し、N a ₂ S O ₄ の上方に通して乾燥させ、濃縮すると粗生成物が得られた。粗生成物を石油エーテル中の 0 % ~ 1 0 0 % の酢酸エチルを用いて溶出させるシリカゲルカラムクロマトグラフィーにかけると、薄茶色の液体として標題化合物 (8 . 0 g) が得られた。 20

¹ H N M R 7 . 5 4 - 7 . 4 8 (m , 3 H) , 7 . 3 9 - 7 . 3 4 (m , 3 H) , 7 . 2 9 - 7 . 2 3 (m , 1 H) , 7 . 0 4 (d , J = 1 5 . 2 H z , 1 H) , 4 . 3 7 (q , J = 6 . 8 H z , 2 H) , 4 . 2 8 (q , J = 6 . 8 H z , 2 H) , 1 . 4 0 - 1 . 2 8 (m , 6 H) .

【 0 1 8 4 】

工程 B : 1 , 3 - ジエチル 2 - [(2 E) - 1 - (ニトロメチル) - 3 - フェニル - 2 - プロペン - 1 - イル] プロパンジオエートの調製

0 のエタノール (6 0 m L) 中の 1 , 3 - ジエチル 2 - [(2 E) - 3 - フェニル - 2 - プロペン - 1 - イリデン] - プロパンジオエート (すなわち、工程 A の生成物、 6 . 0 g , 2 1 . 8 7 m m o l) およびニトロメタン (2 . 0 g , 3 2 . 8 0 m m o l) の溶液にナトリウムメトキシド (1 2 0 m g , 2 . 1 8 m m o l) を加えた。反応混合物を 2 3 で一晩で攪拌した。反応の進行は、薄層クロマトグラフィー分析によって監視した。完了後、反応を減圧下で濃縮し、粗反応塊を酢酸エチル (3 × 4 0 m L) で抽出した。有機相を水 (5 0 m L) で洗浄し、N a ₂ S O ₄ の上方に通して乾燥させ、濃縮すると粗生成物が得られた。粗生成物を石油エーテル中の 0 % ~ 1 0 0 % の酢酸エチルを用いて溶出させるカラムクロマトグラフィーにかけると、薄黄色の固体として標題化合物 (3 . 9 g) が得られた。 30

¹ H N M R 7 . 3 3 - 7 . 2 4 (m , 5 H) , 6 . 5 7 (d , J = 1 6 . 0 H z , 1 H) , 6 . 1 5 - 6 . 0 8 (m , 1 H) , 4 . 7 7 - 4 . 6 6 (m , 2 H) , 4 . 2 5 - 4 . 1 6 (m , 4 H) , 3 . 7 5 - 3 . 7 2 (m , 1 H) , 3 . 6 6 (d , J = 7 . 2 H z , 1 H) , 1 . 2 9 - 1 . 2 0 (m , 6 H) . 40

【 0 1 8 5 】

工程 C : エチル 2 - オキソ - 4 - [(1 E) - 2 - フェニルエテニル] - 3 - ピロリジンカルボキシレートの調製

エタノールおよび水 (9 : 1 , 6 0 m L) の混合液中の 1 , 3 - ジエチル 2 - [(2 E) - 1 - (ニトロメチル) - 3 - フェニル - 2 - プロペン - 1 - イル] プロパンジオエート (すなわち、工程 B の生成物、 3 . 9 g , 1 1 . 6 2 m m o l) 、鉄粉 (3 . 2 5 g , 5 8 . 1 5 m m o l) および塩化アンモニウム (3 1 0 m g , 5 . 8 1 m m o l) の混合物を 2 4 時間にわたり溶媒の還流温度に加熱した。反応の進行は、薄層クロマトグラフィ 50

一分析によって監視した。完了後、反応混合物を濾過し、濾液を減圧下で濃縮すると、粗生成物が得られた。粗生成物を石油エーテル中の0%~100%の酢酸エチルを用いて溶出させるシリカゲルカラムクロマトグラフィーにかけると、薄黄色の液体として標題化合物(1.5g)が得られた。

¹H NMR 7.36~7.23(m, 5H), 6.54(d, J = 15.6 Hz, 1H), 6.18~6.12(m, 1H), 5.94(br s, 1H), 4.26(q, J = 6.8 Hz, 2H), 3.73~3.63(m, 2H), 3.32(d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.25(t, J = 8.4 Hz, 1H), 1.31(t, J = 6.8 Hz, 3H).

【0186】

工程D:N-(2,3-ジフルオロフェニル)-2-オキソ-4-[(1E)-2-フェニルエテニル]-3-ピロリジンカルボキサミドの調製

メタノールおよびテトラヒドロフラン(6:4、20mL)の混合液中の2-オキソ-4-[(1E)-2-フェニルエテニル]-3-ピロリジンカルボキシレート(すなわち、工程Cの生成物、1.5g、5.78mmol)の溶液に1Nの水酸化ナトリウム水溶液を加えた。反応混合物を23で16時間にわたり攪拌した。反応の進行は、薄層クロマトグラフィー分析によって監視した。完了後、反応混合物を0に冷却し、1Nの塩酸で酸性化し、酢酸エチル(3×25mL)で抽出した。有機相を水(20mL)で洗浄し、Na₂SO₄の上方で乾燥させて濃縮すると、中間体酸(1.12g)が得られたので、これをそれ以上精製せずにアミンカップリング工程で直接使用した。0の塩化メチレン(20mL)の中間体酸(0.6g、2.59mmol)、2,3-ジフルオロアニリン(0.4g、3.11mmol)およびトリエチルアミン(1.09mL、7.78mmol)の溶液にプロピルホスホン酸無水物(T3P(登録商標))(1.24g、3.89mmol)を加えた。反応混合物を23で一晩で攪拌した。反応の進行は、薄層クロマトグラフィー分析によって監視した。完了後、反応混合物を水(15mL)中に注入し、ジクロロメタン(3×15mL)で抽出した。有機相を分離し、Na₂SO₄の上方に通して乾燥させ、減圧下で濃縮すると粗生成物が得られた。粗化合物を石油エーテル中の0%~100%の酢酸エチルを用いて溶出させるカラムクロマトグラフィーによって精製すると、オフホワイトの固体(0.5g)として本発明の化合物である標題化合物が得られた。

¹H NMR(DMSO-d₆) 10.23(s, 1H), 8.10(s, 1H), 7.80~7.76(m, 1H), 7.41(d, J = 7.6 Hz, 2H), 7.32(t, J = 7.6 Hz, 2H), 7.24~7.15(m, 3H), 6.52(d, J = 16 Hz, 1H), 6.40~6.34(m, 1H), 3.67(d, J = 9.6 Hz, 1H), 3.60~3.56(m, 1H), 3.49(t, J = 8.8 Hz, 1H), 3.17(t, J = 8.8 Hz, 1H).

【0187】

合成例3

N-(2,3-ジフルオロフェニル)-2-オキソ-4-(2-フェニルエチル)-3-ピロリジンカルボキサミド(化合物35)の調製

工程A:N-(2,3-ジフルオロフェニル)-2-オキソ-4-(2-フェニルエチル)-3-ピロリジン-3-カルボキサミドの調製

エタノール(20mL)中のN-(2,3-ジフルオロフェニル)-2-オキソ-4-[(1E)-2-フェニルエテニル]-3-ピロリジンカルボキサミド(すなわち、実施例2、工程Dの生成物、0.30g、0.87mmol)の溶液を窒素雰囲気下に配置した。パラジウム炭素(10%、0.150g)を加え、反応混合物を2時間にわたり23

の水素バルーン圧下で攪拌した。反応の進行は、薄層クロマトグラフィー分析によって監視した。完了後、反応混合物をCellite(登録商標)硅藻土濾過助剤に通して濾過し、濾液を減圧下で濃縮すると、粗生成物が得られた。粗生成物を石油エーテル中の0%~100%の酢酸エチルを用いて溶出させるシリカゲルカラムクロマトグラフィーによっ

10

20

30

40

50

て精製すると、無色の固体(0.20g)として本発明の化合物である標題化合物が得られた。

¹H NMR(DMSO-d₆) 10.24(s, 1H), 7.98(s, 1H), 7.79-7.76(m, 1H), 7.29-7.16(m, 7H), 3.46-3.39(m, 2H), 2.94(t, J=8.8Hz, 1H), 2.77-2.71(m, 1H), 2.59(t, J=8.0Hz, 2H), 1.86-1.74(m, 2H).

【0188】

合成例4

4-[2-(3-クロロフェニル)エチニル]N-(2-フルオロフェニル)-2-オキソ3-ピロリジンカルボキサミド(化合物25)の調製

10

工程A: 3-(3-クロロフェニル)-2-プロピナールの調製

工程B: 1,3-ジエチル2-[3-(3-クロロフェニル)-2-プロピン-1-イリデン]プロパンジオエートの調製

工程C: 1,3-ジエチル2-[3-(3-クロロフェニル)-1-(ニトロメチル)-2-プロピン-1-イル]プロパンジオエートの調製

工程D: エチル4-[2-(3-クロロフェニル)エチニル]-2-オキソ-3-ピロリジンカルボン酸の調製

工程E: 4-[2-(3-クロロフェニル)エチニル]-2-オキソ-3-ピロリジンカルボン酸の調製

20

工程F: 4-[2-(3-クロロフェニル)エチニル]-N-(2-フルオロフェニル)-2-オキソ-3-ピロリジンカルボキサミドの調製

【0189】

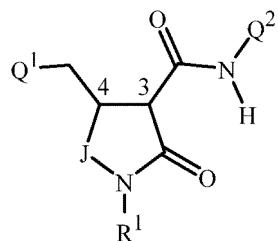
当技術分野において公知の方法と一緒に本明細書に記載した手法によって、以下の表1~320の化合物を調製することができる。下記の表では、以下の略語を使用する: iはイソを意味し、cはシクロを意味し、Meはメチルを意味し、Etはエチルを意味し、Prはプロピルを意味し、Buはブチルを意味し、i-Prはイソプロピルを意味し、c-Prはシクロプロピルを意味し、Phはフェニルを意味し、OMeはメトキシを意味し、OEtはエトキシを意味し、SMeはメチルチオを意味し、NHMeはメチルアミノを意味し、CNはシアノを意味し、NO₂はニトロを意味し、TMSはトリメチルシリルを意味し、SOMeはメチルスルフィニルを意味し、C₂F₅はCF₂CF₃を意味し、およびSO₂Meはメチルスルホニルを意味する。

30

【0190】

表1

【化29】



40

J = -CH₂-であり；R¹ = Hであり；Q² = Ph(2-F)であり；およびQ¹ =

【0191】

【表1】

$J=-CH_2-$ であり; $R^1=H$ であり; $Q^2=Ph(2-F)$ であり; および $Q^1=$

Q^1	Q^1	Q^1
Ph(3-Cl)	Ph(3-Et)	Ph(3-OCF ₂ H)
Ph(3-F)	Ph(3-CF ₃)	Ph(3-O-i-Pr)
Ph(3-Br)	Ph(3-CH ₂ CF ₃)	Ph(3-OMe)
Ph(3-Me)	Ph(3-OCF ₃)	Ph(3-OCF ₂ CF ₂ H)

10

【0 1 9 2】

【表2】

Q ¹	Q ¹	Q ¹
Ph(2-Cl)	2-ピリジニル(6-CF ₃)	2-チエニル
Ph(2-F)	2-ピリジニル(6-Me)	2-チエニル(4-CF ₃)
Ph(2-Br)	2-ピリジニル(5-F)	2-チエニル(5-CF ₃)
Ph(2-Me)	2-ピリジニル(5-CF ₃)	3-チエニル
Ph(2-CF ₃)	2-ピリジニル(5-Me)	3-チエニル(4-CF ₃)
Ph(2-OCF ₃)	2-ピリジニル(4-F)	3-チエニル(5-CF ₃)
Ph(2-OCF ₂ H)	2-ピリジニル(4-CF ₃)	2-フリル
Ph(2-OMe)	2-ピリジニル(4-Me)	2-フリル(4-CF ₃)
Ph(2-OCF ₂ CF ₂ H)	2-ピリジニル(3-F)	2-フリル(5-CF ₃)
Ph(2-CH ₂ CF ₃)	2-ピリジニル(3-CF ₃)	3-フリル
Ph(2-O-i-Pr)	2-ピリジニル(3-Me)	3-フリル(4-CF ₃)
Ph(4-Cl)	3-ピリジニル	3-フリル(5-CF ₃)
Ph(4-F)	3-ピリジニル(6-F)	1H-ピラゾール-1-イル
Ph(4-Br)	3-ピリジニル(6-CF ₃)	4-CF ₃ -1H-ピラゾール-1-イル
Ph(4-Me)	3-ピリジニル(6-Me)	1H-イミダゾール-1-イル
Ph(4-Et)	3-ピリジニル(5-F)	4-CF ₃ -1H-イミダゾール-1-イル
Ph(4-CF ₃)	3-ピリジニル(5-CF ₃)	2-CF ₃ -1H-イミダゾール-1-イル
Ph(4-OCF ₃)	3-ピリジニル(5-Me)	1-Me-1H-イミダゾール-2-イル
Ph(4-OCF ₂ H)	3-ピリジニル(4-F)	1-Me-1H-イミダゾール-4-イル
Ph(4-OMe)	3-ピリジニル(4-CF ₃)	3-Me-1H-イミダゾール-4-イル
Ph(4-CH ₂ CF ₃)	3-ピリジニル(4-Me)	1-Me-1H-ピラゾール-4-イル
Ph(4-O-i-Pr)	3-ピリジニル(2-F)	1-Me-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル
Ph(4-OCF ₂ CF ₂ H)	3-ピリジニル(2-CF ₃)	2-Me-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル
Ph(2,3-ジ-F)	3-ピリジニル(2-Me)	4-Me-1H-1,2,3-トリアゾール-2-イル
Ph(2,4-ジ-F)	4-ピリジニル	4-Me-1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル
Ph(2,5-ジ-F)	4-ピリジニル(6-F)	ピラジン-2-イル
Ph(2,6-ジ-F)	4-ピリジニル(6-CF ₃)	ピラジン-2-イル(5-CF ₃)
Ph(3,4-ジ-F)	4-ピリジニル(6-Me)	ピリミジン-2-イル
Ph(3,5-ジ-F)	4-ピリジニル(5-F)	ピリミジン-2-イル(5-CF ₃)
Ph(3-Me,4-F)	4-ピリジニル(5-CF ₃)	ピリミジン-5-イル
Ph(3-F,4-Me)	4-ピリジニル(5-Me)	ピリミジン-5-イル(2-CF ₃)
Ph(3-CF ₃ ,4-F)	4-ピリジニル(3-F)	1,3,5-トリアジン-2-イル
Ph(3-F,4-CF ₃)	4-ピリジニル(3-CF ₃)	チアゾール-2-イル
Ph(2,3,4-トリ-F)	4-ピリジニル(3-Me)	チアゾール-2-イル(5-CF ₃)
Ph(3,4,5-トリ-F)	4-ピリジニル(2-F)	チアゾール-5-イル
2-ピリジニル	4-ピリジニル(2-CF ₃)	チアゾール-5-イル(2-CF ₃)
2-ピリジニル(6-F)	4-ピリジニル(2-Me)	オキサゾール-2-イル

【0193】

【表3】

Q^1	Q^1	Q^1
オキサゾール-2-イル(5-CF ₃)	1,4-ジオキソラン-2-イル	Ph(3-SCF ₃)
オキサゾール-5-イル	1,4-ジチオラン-2-イル	Ph(3-S- <i>c</i> -Pr)
オキサゾール-5-イル(2-CF ₃)	1-ナフチル	Ph(3-SOMe)
イソチアゾール-5-イル	2-ナフチル	Ph(3-SOCF ₃)
イソチアゾール-5-イル(3-CF ₃)	ベンゾフラン-2-イル	Ph(3-SO- <i>c</i> -Pr)
イソチアゾール-3-イル	ベンゾチオフェン-2-イル	Ph(3-SO ₂ Me)
イソチアゾール-3-イル(5-CF ₃)	1,3-ベンゾキサゾール-2-イル	Ph(3-SO ₂ CF ₃)
イソキサゾール-5-イル	1,3-ベンゾチアゾール-2-イル	Ph(3-SO ₂ - <i>c</i> -Pr)
イソキサゾール-5-イル(3-CF ₃)	7-キノリニル	Ph(3-プロパルギル)
イソキサゾール-3-イル	インダゾール-1-イル	Ph(3-(2-ブチニル))
イソキサゾール-3-イル(5-CF ₃)	ベンズイミダゾール-1-イル	Ph(2-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃)
1 <i>H</i> -1,2,3,4-テトラゾール-1-イル	インドール-1-イル	Ph(2-CF ₃)
5-Me-1 <i>H</i> -1,2,3,4-テトラゾール-1-イル	ピロロ[2,3- <i>c</i>]ピリジン-1-イル	Ph(3-CF ₃)
1-Me-1 <i>H</i> -1,2,3,4-テトラゾール-5-イル	Ph(3-OCH ₂ - <i>c</i> -Pr)	Ph(2-C(=O)CH ₃)
1 <i>H</i> -1,2,4-トリアゾール-1-イル	Ph(2-OCH ₂ - <i>c</i> -Pr)	Ph(2-OC(=O)CH ₃)
1,3,4-オキサジアゾール-2-イル	Ph(4-O(CH ₂) ₄ - <i>c</i> -hex)	Ph(3-OC(=O)CH ₃)
1,3,4-チアジアゾール-2-イル	Ph(CH ₂ - <i>c</i> -Pr)	Ph(2-OC(=O)CF ₃)
1,2,4-オキサジアゾール-3-イル	Ph(4-(CH ₂) ₄ - <i>c</i> -hex)	Ph(3-OC(=O)CF ₃)
1,2,4-チアジアゾール-3-イル	Ph(3-OCH ₂ CF ₂))	
テトラヒドロピラン-2-イル	Ph(2-(3,3-ジクロロアリルオキシ))	
テトラヒドロピラン-3-イル	Ph(2-メトキシエトキシ)	
テトラヒドロフラン-2-イル	Ph(3-プロポキシプロポキシ)	
テトラヒドロフラン-3-イル	Ph(2-CH ₂ CH ₂ SCH ₃)	
1,3-ジオキソラン-4-イル	Ph(2-CH ₂ CH ₂ SOCH ₃)	
2,2-ジ-F-1,3-ジオキソラン-4-イル	Ph(2-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃)	
1,3-ジチオラン-4-イル	Ph(3-SMe)	

【0194】

表2は、行見出し「 $J = -CH_2-$ であり； $R^1 = H$ であり； $Q^2 = Ph(2-F)$ であり；および $Q^1 =$ 」が、以下の表2に列挙した行見出し（すなわち、「 $J = -CH_2-$ であり； $R^1 = H$ であり； $Q^2 = Ph(2,3-F)$ であり；および $Q^1 =$ 」）で置き換えられていることを除いて、同じように構成されている。このため、表2中の最初の記入事項は、式1（式中、 J は $-CH_2-$ であり； R^1 は H であり； Q^2 は $Ph(2,3-F)$ であり；および Q^1 は $Ph(3-C1)$ （すなわち、3-クロロフェニル）である）の化合物である。表3～40は、同様に構成されている。

【0195】

【表4】

表	行見出し
2	$J=-CH_2-$ であり； $R^1=H$ であり； $Q^2=Ph(2,3-F)$ であり；および $Q^1=$
3	$J=-CH_2-$ であり； $R^1=H$ であり； $Q^2=Ph(2,4-F)$ であり；および $Q^1=$
4	$J=-CH_2-$ であり； $R^1=H$ であり； $Q^2=Ph(2,3,4-F)$ であり；および $Q^1=$
5	$J=-CH_2-$ であり； $R^1=H$ であり； $Q^2=Ph(2-CF_3)$ であり；および $Q^1=$

10

20

30

40

50

【0196】

【表5】

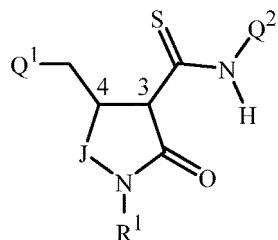
6	J=-CH ₂ -であり;R ¹ =H であり;Q ² =Ph(2-Me)であり;および Q ¹ =
7	J=-CH ₂ -であり;R ¹ =H であり;Q ² =Ph(2-NO ₂)であり;および Q ¹ =
8	J=-CH ₂ -であり;R ¹ =H であり;Q ² =Ph(2-Cl)であり;および Q ¹ =
9	J=-CH ₂ -であり;R ¹ =H であり;Q ² =Ph(2-SO ₂ Me)であり;および Q ¹ =
10	J=-CH ₂ -であり;R ¹ =H であり;Q ² =Ph(2-F,3-Cl)であり;および Q ¹ =
11	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =H であり;Q ² =Ph(2-F)であり;および Q ¹ =
12	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =H であり;Q ² =Ph(2,3-ジ-F)であり;および Q ¹ =
13	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =H であり;Q ² =Ph(2,4-ジ-F)であり;および Q ¹ =
14	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =H であり;Q ² =Ph(2,3,4-トリ-F)であり;および Q ¹ =
15	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =H であり;Q ² =Ph(2-CF ₃)であり;および Q ¹ =
16	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =H であり;Q ² =Ph(2-Me)であり;および Q ¹ =
17	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =H であり;Q ² =Ph(2-NO ₂)であり;および Q ¹ =
18	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =H であり;Q ² =Ph(2-Cl)であり;および Q ¹ =
19	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =H であり;Q ² =Ph(2-SO ₂ Me)であり;および Q ¹ =
20	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =H であり;Q ² =Ph(2-F,3-Cl)であり;および Q ¹ =
21	J=-CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2-F)であり;および Q ¹ =
22	J=-CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2,3-ジ-F)であり;および Q ¹ =
23	J=-CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2,4-ジ-F)であり;および Q ¹ =
24	J=-CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2,3,4-トリ-F)であり;および Q ¹ =
25	J=-CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2-CF ₃)であり;および Q ¹ =
26	J=-CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2-Me)であり;および Q ¹ =
27	J=-CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2-NO ₂)であり;および Q ¹ =
28	J=-CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2-Cl)であり;および Q ¹ =
29	J=-CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2-SO ₂ Me)であり;および Q ¹ =
30	J=-CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2-F,3-Cl)であり;および Q ¹ =
31	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2-F)であり;および Q ¹ =
32	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2,3-ジ-F)であり;および Q ¹ =
33	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2,4-ジ-F)であり;および Q ¹ =
34	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2,3,4-トリ-F)であり;および Q ¹ =
35	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2-CF ₃)であり;および Q ¹ =
36	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2-Me)であり;および Q ¹ =
37	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2-NO ₂)であり;および Q ¹ =
38	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2-Cl)であり;および Q ¹ =
39	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2-SO ₂ Me)であり;および Q ¹ =
40	J=-CH ₂ CH ₂ -であり;R ¹ =Me であり;Q ² =Ph(2-F,3-Cl)であり;および Q ¹ =

【0197】

表41

表41は、構造が下記の構造：

【化30】



10

と取り換えられることを除いて、上記の表1と同じ方法で構成されている。

【0198】

表42～80

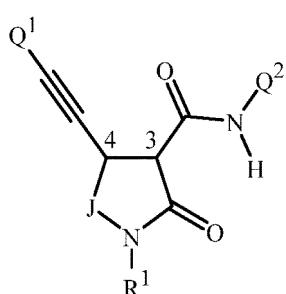
本開示は、さらに表42～80を含むが、各表は、構造が上記の表41の構造と取り換えられることを除いて、上記の表2～40と同一方法で構成されている。

【0199】

表81

表81は、構造が下記の構造：

【化31】



20

と取り換えられることを除いて、上記の表1と同じ方法で構成されている。

30

【0200】

表82～120

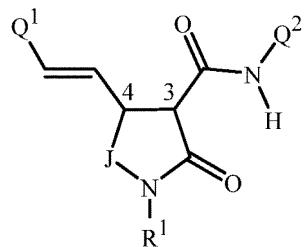
本開示は、さらに表82～120を含むが、各表は、構造が上記の表81の構造と取り換えられることを除いて、上記の表2～40と同一方法で構成されている。

【0201】

表121

表121は、構造が下記の構造：

【化32】



40

と取り換えられることを除いて、上記の表1と同じ方法で構成されている。

【0202】

表122～160

50

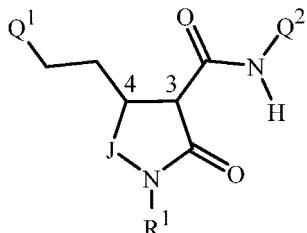
本開示は、さらに表122～160を含むが、各表は、構造が上記の表121の構造と取り換えられることを除いて、上記の表2～40と同一方法で構成されている。

【0203】

表161

表161は、構造が下記の構造：

【化33】



10

と取り換えられることを除いて、上記の表1と同じ方法で構成されている。

【0204】

表162～200

本開示は、さらに表162～200を含むが、各表は、構造が上記の表161の構造と取り換えられることを除いて、上記の表2～40と同一方法で構成されている。

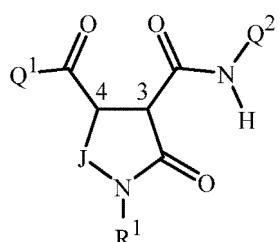
20

【0205】

表201

表201は、構造が下記の構造：

【化34】



30

と取り換えられることを除いて、上記の表1と同じ方法で構成されている。

【0206】

表202～240

本開示は、さらに表202～240を含むが、各表は、構造が上記の表201の構造と取り換えられることを除いて、上記の表2～40と同一方法で構成されている。

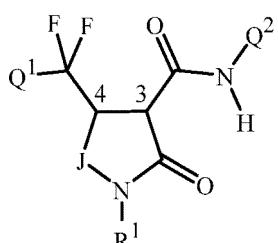
【0207】

表241

40

表241は、構造が下記の構造：

【化35】



50

と取り換えられることを除いて、上記の表1と同じ方法で構成されている。

【0208】

表242～280

本開示は、さらに表242～280を含むが、各表は、構造が上記の表241の構造と取り換えられることを除いて、上記の表2～40と同一方法で構成されている。

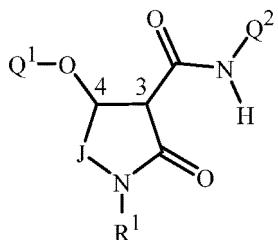
【0209】

表281

表281は、構造が下記の構造：

【化36】

10



と取り換えられることを除いて、上記の表1と同じ方法で構成されている。

20

【0210】

表282～320

本開示は、さらに表282～320を含むが、各表は、構造が上記の表281の構造と取り換えられることを除いて、上記の表2～40と同一方法で構成されている。

【0211】

製剤 / 実用性

本発明の化合物は、一般に、組成物、すなわち製剤中の除草性有効成分として、担体として機能する界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1つの追加の構成成分とともに使用されるであろう。製剤もしくは組成物成分は、有効成分の物理特性、適用様式ならびに例えば土壤タイプ、水分および温度などの環境因子と調和するように選択される。

30

【0212】

有用な製剤には、液体組成物および固体組成物の両方が含まれる。液体組成物には、任意選択的に増粘してゲルにすることができる、溶液（乳化性濃縮物を含む）、懸濁液、エマルジョン（マイクロエマルジョン、水中油型エマルジョン、流動性濃縮物および／またはサスペンションを含む）などが含まれる。水性液体組成物の一般的なタイプは、可溶性濃縮液、懸濁濃縮液、カプセル懸濁液、濃縮エマルジョン、マイクロエマルジョン、水中油型エマルジョン、流動性濃縮液およびサスペンションである。一般的なタイプの非水性液体組成物は、乳化性濃縮物、マイクロ乳化性濃縮物、分散性濃縮物および油分散系である。

40

【0213】

固体組成物の一般的なタイプは、粉剤、粉末、顆粒、ペレット、プリル、芳香錠、錠剤、充填フィルム（種子コーティングを含む）などであり、これらは、水分散性（「湿潤性」）または水溶性であってよい。フィルム形成溶液または流動性懸濁液から形成されたフィルムおよびコーティングは、種子処理用に特に有用である。有効成分は、（マイクロ）カプセル化し、さらに懸濁液または固体調合物にすることができるか；あるいはまた有効成分の全体調合物は、カプセル化する（または「上塗りする」）ことができる。カプセル化は、有効成分の放出を制御する、または遅くすることができる。乳化性顆粒は、乳化性濃縮物調合物および乾燥粒状調合物の両方の利点を兼ね備える。高濃度組成物は、主としてさらなる製剤への中間体として使用される。

50

【0214】

噴霧可能な製剤は、典型的には、噴霧前に好適な媒体中で希釈される。そのような液体および固体調合物は、調合されて噴霧媒体、通常水、しかし時々、芳香族またはパラフィン系炭化水素または植物油のような別の好適な媒体に容易に希釈される。噴霧量は、約1～数千L（リットル）/ha（ヘクタール）の範囲内にあってよいが、より典型的には、約10～数百L/haの範囲内にある。噴霧可能な製剤は、水、または空中もしくは地上散布による葉の処理のために、または植物の生育培地への適用のために好適な他の媒体とタンク中で混合することができる。液体および乾燥製剤は、点滴灌漑システムに直接的に計量しながら供給することができる、または植え付け中に敵間に計量しながら供給することができる。

10

【0215】

製剤は、典型的には、合計で100重量%となる以下のようその範囲内で有効量の有効成分、希釈剤および界面活性剤を含有するであろう。

【0216】

【表6】

	重量%		
	有効成分	希釈剤	界面活性剤
水分散性および水溶性の顆粒、錠剤および粉末	0.001-90	0-99.999	0-15
油分散液、懸濁液、エマルジョン、液剤(乳剤を含む)	1-50	40-99	0-50
粉剤	1-25	70-99	0-5
顆粒およびペレット	0.001-99	5-99.999	0-15
高力価組成物	90-99	0-10	0-2

20

【0217】

固体希釈剤には、例えば、ベントナイト、モンモリロナイト、アタパルジャイトおよびカオリンなどの粘土、石膏、セルロース、二酸化チタン、酸化亜鉛、デンブン、デキストリン、糖類（例えば、ラクトース、サッカロース）、シリカ、タルク、雲母、珪藻土、尿素、炭酸カルシウム、炭酸および重炭酸ナトリウム、ならびに硫酸ナトリウムが含まれる。典型的な固体希釈剤は、Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jerseyに記載されている。

30

【0218】

液体希釈剤には、例えば、水、N,N-ジメチルアルカンアミド（例えば、N,N-ジメチルホルムアミド）、リモネン、ジメチルスルホキシド、N-アルキルピロリドン（例えば、N-メチルピロリジノン）、アルキルリン酸塩（例えば、リン酸トリエチル）、エチレングリコール、トリエチレングリコール、プロピレングリコール、ジプロピレングリコール、ポリプロピレングリコール、プロピレンカーボネート、ブチレンカーボネート、パラフィン（例えば、白色鉱油、正パラフィン、イソパラフィン）、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、グリセリン、グリセロールトリアセテート、ソルビトール、芳香族炭化水素、脱芳香族化脂肪族、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、例えばシクロヘキサン、2-ヘプタノン、イソホロンおよび4-ヒドロキシ-4-メチル-2-ペンタノンなどのケトン、例えば酢酸イソアミル、酢酸ヘキシル、酢酸ヘプチル、酢酸オクチル

40

50

、酢酸ノニル、酢酸トリデシルおよび酢酸イソボルニルなどの酢酸塩、例えばアルキル化乳酸エステル、二塩基性エステル、アルキルおよびアリール安息香酸塩および - プチロラクトンなどの他のエステル、ならびに例えばメタノール、エタノール、n - プロパノール、イソプロピルアルコール、n - ブタノール、イソブチルアルコール、n - ヘキサノール、2 - エチルヘキサノール、n - オクタノール、デカノール、イソデシルアルコール、イソオクタデカノール、セチルアルコール、ラウリルアルコール、トリデシルアルコール、オレイルアルコール、シクロヘキサノール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ジアセトンアルコール、クレゾールおよびベンジルアルコールなどの直鎖状、分岐状、飽和もしくは不飽和であってよいアルコールが含まれる。液体希釈剤には、さらに植物種子および果実油（例えば、オリーブ、ヒマ、亜麻仁、ゴマ、コーン（トウモロコシ）、ラッカセイ、ヒマワリ、ブドウ種子、ベニバナ、綿実、ダイズ、ナタネ、ココナツおよびバーム核の油）、動物性脂肪（例えば、牛脂、豚脂、ラード、タラ肝油、魚油）ならびにこれらの混合物などの飽和および不飽和脂肪酸（典型的にはC₆ ~ C₂₂）のグリセロールエステルが含まれる。液体希釈剤にはまた、アルキル化（例えば、メチル化、エチル化、ブチル化）脂肪酸であって、脂肪酸が植物および動物源からのグリセロールエステルの加水分解によって得られてもよいし、蒸留によって精製することができる脂肪酸が含まれる。典型的な液体希釈剤は、Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950に記載されている。
10

【0219】

本発明の固体および液体組成物は、1種以上の界面活性剤を含むことが多い。液体に添加される場合、界面活性剤（surfactant）（「界面活性剤（surface-active agent）」としても知られる）は一般に、液体の表面張力を変化させ、ほとんどの場合低下させる。界面活性剤分子中の親水性および親油性基の性質に依存して、界面活性剤は、潤滑剤、分散剤、乳化剤または消泡剤として有用であり得る。
20

【0220】

界面活性剤は、非イオン、アニオンまたはカチオン界面活性剤として分類することができる。本組成物に有用な非イオン界面活性剤には、（分岐状もしくは直鎖状であってもよい）天然および合成アルコールをベースとする、そしてアルコールと、エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはそれらの混合物とから製造されるアルコールアルコキシレートなどのアルコールアルコキシレート；アミンエトキシレート、アルカノールアミドおよびエトキシル化アルカノールアミド；エトキシル化大豆油、ヒマシ油および菜種油などのアルコキシル化トリグリセリド；（フェノール類とエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはそれらの混合物とから製造される）オクチルフェノールエトキシレート、ノニルフェノールエトキシレート、ジノニルフェノールエトキシレートおよびドデシルフェノールエトキシレートなどのアルキルフェノールアルコキシレート；エチレンオキシドまたはプロピレンオキシドと末端プロックがプロピレンオキシドから調製されている逆プロックポリマーとから製造されるプロックポリマー；エトキシル化脂肪酸；エトキシル化脂肪酸エステルおよび油；エトキシル化メチルエステル；エトキシル化トリスチリルフェノール（エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはそれらの混合物から製造されるものを含む）；脂肪酸エスエル、グリセロールエステル、ラノリンベースの誘導体、ポリエトキシル化ソルビタン脂肪酸エステル、ポリエトキシル化ソルビトール脂肪酸エステルおよびポリエトキシル化グリセロール脂肪酸エステルなどのポリエトキシレートエステル；ソルビタンエステルなどの他のソルビタン誘導体；ランダムコポリマー、ブロックコポリマー、アルキッドpeg（ポリエチレングリコール）樹脂、グラフトもしくは櫛形ポリマーおよび星形ポリマーなどの高分子界面活性剤；ポリエチレングリコール（peg）；ポリエチレングリコール脂肪酸エステル；シリコーンベースの界面活性剤；ならびにサッカロースエステル、アルキルポリグリコシドおよびアルキル多糖類などの糖誘導体が含まれるが、それらに限定されない。
30
40

【0221】

有用なアニオン界面活性剤には、アルキルアリールスルホン酸およびそれらの塩；カル
50

ボキシル化アルコールまたはアルキルフェノールエトキシレート；ジフェニルスルホン酸塩誘導体；リグニンおよびリグノスルホン酸塩などのリグニン誘導体；マレイン酸もしくはコハク酸またはそれらの無水物；オレフィンスルホン酸塩；アルコールアルコキシレートのリン酸エステル、アルキルフェノールアルコキシレートのリン酸エステルおよびスチリルフェノールエトキシレートのリン酸エステルなどのリン酸エステル；タンパク質ベースの界面活性剤；サルコシン誘導体；スチリルフェノールエーテル硫酸塩；油および脂肪酸の硫酸塩およびスルホン酸塩；エトキシル化アルキルフェノールの硫酸塩およびスルホン酸塩；アルコールの硫酸塩；エトキシル化アルコールの硫酸塩；N, N-アルキルタウリン塩などのアミンおよびアミドのスルホン酸塩；ベンゼン、クメン、トルエン、キシレン、ならびにドデシルおよびトリデシルベンゼンのスルホン酸塩；縮合ナフタレンのスルホン酸塩；ナフタレンおよびアルキルナフタレンのスルホン酸塩；分別石油のスルホン酸塩；スルホコハク酸塩；ならびにジアルキルスルホコハク酸塩などのスルホコハク酸塩およびそれらの誘導体が含まれるが、それらに限定されない。10

【0222】

有用なカチオン界面活性剤には、アミドおよびエトキシル化アミド；N-アルキルプロパンジアミン、トリプロピレントリアミンおよびジプロピレンテトラアミン、ならびに（アミンと、エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはそれらの混合物とから製造される）エトキシル化アミン、エトキシル化ジアミンおよびプロポキシル化アミンなどのアミン；アミン酢酸塩などのアミン塩およびジアミン塩；第四級塩、エトキシル化第四級塩およびジ第四級塩などの第四級アンモニウム塩；ならびにアルキルジメチルアミンオキシドおよびビス-（2-ヒドロキシエチル）-アルキルアミンオキシドなどのアミンオキシドが含まれるが、それらに限定されない。20

【0223】

非イオン界面活性剤とアニオン界面活性剤との混合物または非イオン界面活性剤とカチオン界面活性剤との混合物もまた、本組成物に有用である。非イオン、アニオンおよびカチオン界面活性剤ならびにそれらの推奨される使用は、McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. によって出版された McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, annual American and International Editions; Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; および A. S. Davidson and B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987 を含む様々な出版された参考文献に開示されている。30

【0224】

本発明の組成物はまた、調合助剤として当業者に公知の、調合補助剤および添加剤を含有してもよい（それらのいくつかは、固体希釈剤、液体希釈剤または界面活性剤としてもまた機能すると考えられ得る）。そのような調合補助剤および添加剤は、pH（緩衝剤）、処理中の発泡（ポリオルガノシロキサンなどの消泡剤）、有効成分の沈降（懸濁剤）、粘度（チキソトロピック増粘剤）、容器中の微生物増殖（抗菌剤）、製品凍結（不凍剤）、色（染料／顔料分散系）、洗脱（フィルム形成剤またはステッカー）、蒸発（蒸発遅延剤）および他の調合属性を制御することができる。フィルム形成剤には、例えば、ポリ酢酸ビニル、ポリ酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルアルコール、ポリビニルアルコールコポリマーおよびワックスが含まれる。調合補助剤および添加物の例としては、McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. によって出版された McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, annual International and 4050

North American editions および PCT 公開国際公開第 03 / 024222 号パンフレットにリストアップされているものが挙げられる。

【0225】

式 1 の化合物および任意の他の有効成分は典型的には、有効成分を溶媒に溶解させることによって、または液体もしくは乾燥希釈剤中ですり潰すことによって本組成物中へ組み込まれる。乳化性濃縮液を含む液剤は、処方成分を単純に混合することによって調製することができる。乳化性濃縮液として使用することが意図されている液体組成物の溶媒が水に不混和性である場合、乳化剤は、典型的には水を用いた希釈時に有効成分含有溶媒が乳化させるために添加される。2,000 μm 以下の粒径を有する有効成分スラリーは、3 μm 未満の平均直径を有する粒子を得るために、媒体ミルを用いて湿潤粉碎することができる。水性スラリーは、最終懸濁濃縮液（例えば、米国特許第 3,060,084 号明細書を参照されたい）とするか、または水分散性顆粒を形成するために噴霧乾燥によりさらに加工することができる。乾燥剤は、通常は、2 ~ 10 μm の範囲内の平均粒径を生じさせる乾式粉碎プロセスを必要とする。粉剤および粉末は、ブレンド工程および通常は（ハンマーミルまたは流体エネルギーミルなどを用いて）粉碎工程により調製することができる。顆粒およびペレットは、事前に形成した粒状担体に有効成分物質を噴霧することにより、または凝集技術により調製することができる。Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp 147-48、Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 およびそれに続くもの、ならびに国際公開第 91/13546 号パンフレットを参照されたい。ペレットは、米国特許第 4,172,714 号明細書に記載されたように調製することができる。水分散性および水溶性顆粒は、米国特許第 4,144,050 号明細書、同第 3,920,442 号明細書および独国特許第 3,246,493 号明細書に教示されたように調製することができる。錠剤は、米国特許第 5,180,587 号明細書、同第 5,232,701 号明細書および同第 5,208,030 号明細書に教示されたように調製することができる。フィルムは、英国特許 2,095,558 号明細書および米国特許第 3,299,566 号明細書に教示されたように調製することができる。

【0226】

調合物の技術分野に関するさらなる情報については、T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture", Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133 を参照されたい。さらに、米国特許第 3,235,361 号明細書第 6 欄第 16 行～第 7 欄第 19 行および実施例 10～41；米国特許第 3,309,192 号明細書第 5 欄第 43 行～第 7 欄第 62 行ならびに実施例 8、12、15、39、41、52、53、58、132、138～140、162～164、166、167 および 169～182；米国特許第 2,891,855 号明細書第 3 欄第 66 行～第 5 欄第 17 行および実施例 1～4；Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96；Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989；ならびに Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000 を参照されたい。

10

20

30

40

50

【0227】

以下の実施例において、すべてのパーセンテージは重量 % であり、すべての製剤は従来方法で調製される。化合物番号は、索引表 A 中の化合物を指す。これ以上詳述しなくとも、先行記載を用いる当業者は、本発明を最大限に利用することができると考えられる。以下の実施例は、このため、単に例示的なものであり、何であれ決して本開示を限定するものではないと解釈されるべきである。パーセンテージは、他に指示された場合を除いて重量 % である。

【0228】

【表 7】

10

実施例 A高力価濃縮液

化合物 1	98.5%
シリカエーロゲル	0.5%
合成非晶質微細シリカ	1.0%

【0229】

【表 8】

20

実施例 B湿潤性粉末

化合物 1	65.0%
ドデシルフェノール-ポリエチレングリコールエーテル	2.0%
リグニンスルホン酸ナトリウム	4.0%
ケイアルミン酸ナトリウム	6.0%
モンモリロナイト(焼成)	23.0%

【0230】

【表 9】

30

実施例 C顆粒

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

【0231】

40

【表 1 0】

実施例 D押出しペレット

化合物 1	25.0%	
無水硫酸ナトリウム	10.0%	
粗リグニンスルホン酸カルシウム	5.0%	
アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム	1.0%	
カルシウム/マグネシウムベントナイト	59.0%	10

【0 2 3 2】

【表 1 1】

実施例 E乳化性濃縮液

化合物 1	10.0%	
ヘキサオレイン酸ポリオキシエチレンソルビトール	20.0%	
C ₆ ~C ₁₀ 脂肪酸メチルエステル	70.0%	20

【0 2 3 3】

【表 1 2】

実施例 Fマイクロエマルジョン

化合物 1	5.0%	
ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー	30.0%	
アルキルポリグリコシド	30.0%	
グリセリルモノオレエート	15.0%	30
水	20.0%	

【0 2 3 4】

【表 1 3】

実施例 G懸濁剤濃縮液

化合物 1	35%	
ブチルポリオキシエチレン/ポリプロピレンブロックコポリマー	4.0%	40
ステアリン酸/ポリエチレングリコールコポリマー	1.0%	
スチレンアクリルポリマー	1.0%	
キサンタンゴム	0.1%	
プロピレングリコール	5.0%	
シリコーン系消泡剤	0.1%	
1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン	0.1%	
水	53.7%	

【0235】

【表14】

実施例Hエマルジョン水溶液

化合物1	10.0%	
ブチルポリオキシエチレン/ポリプロピレンブロックコポリマー	4.0%	
ステアリン酸/ポリエチレングリコールコポリマー	1.0%	
スチレンアクリルポリマー	1.0%	10
キサンタンゴム	0.1%	
プロピレングリコール	5.0%	
シリコーン系消泡剤	0.1%	
1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン	0.1%	
芳香族石油系炭化水素	20.0	
水	58.7%	

【0236】

【表15】

実施例I

20

油分散液

化合物1	25%	
ヘキサオレイン酸ポリオキシエチレンソルビトール	15%	
有機改質ベントナイト粘土	2.5%	
脂肪酸メチルエステル	57.5%	

【0237】

本開示はさらに、上記の実施例A～Iのそれぞれにおいて「化合物1」が「化合物2」、「化合物3」、「化合物4」、「化合物5」、「化合物7」、「化合物8」、「化合物9」、「化合物10」、「化合物11」、「化合物12」、「化合物13」、「化合物14」、「化合物15」、「化合物16」、「化合物17」、「化合物18」、「化合物19」、「化合物20」、「化合物21」、「化合物22」、「化合物23」、「化合物24」、「化合物25」、「化合物26」、「化合物27」、「化合物28」、「化合物29」、「化合物30」、「化合物31」、「化合物32」、「化合物33」、「化合物34」または「化合物35」と取り換えられることを除いて、上記の調製例A～Iも含む。

【0238】

試験結果は、本発明の化合物が、高度に活性な発芽前および／または発芽後除草剤および／または植物成長抑制剤であることを示している。本発明の化合物は、一般に、発芽後雑草防除（すなわち、土壤から雑草の実生が出現した後に適用される）および発芽前雑草防除（すなわち、土壤から雑草の実生が出現する前に適用される）に対して最高活性を示す。それらの多くは、例えば燃料貯蔵タンクの周囲、産業用貯蔵領域、駐車場、ドライブインシアター、飛行場、河岸、灌漑用水路やその他の水路、広告看板の周囲および幹線道路構造物や鉄道構造物などのすべての植生の完全な防除が望ましい領域における広範囲の発芽前および／または発芽後雑草防除に対して実用性を有する。本発明の化合物の多くは、作物対雑草における選択性的代謝によって、または作物および雑草における生理的阻害の場所での選択性的活性によって、または作物および雑草の混合物の環境上もしくは環境内への選択性的配置によって、作物／雑草混合物中における草および広葉雑草の選択性的防除にとって有用である。当業者であれば、化合物または化合物群内のこれらの選択性因子の好ましい組み合わせが、日常的な生物学的および／または生化学的アッセイを実施する

40

50

ことによって容易に決定できることを認識できるであろう。本発明の化合物は、これらに限定されないが、アルアルファ、オオムギ、綿、コムギ、セイヨウアブラナ、サトウダイコン、コーン(トウモロコシ)、ソルガム、ダイズ、イネ、オートムギ、ラッカセイ、野菜類、トマト、ジャガイモ；コーヒー、カカオ、アブラヤシ、ゴム、サトウキビ、柑橘類、ブドウ、果樹、堅果のなる木、バナナ、プランテン、パイナップル、ホップ、茶を含む多年生のプランテーション作物；およびユーカリや針葉樹(例えば、タエダマツ)などの森林；ならびに、芝生種(例えば、ケンタッキーブルーグラス、イヌシバ、ケンタッキー・シノケグサおよびバミューダグラス)を含む重要な農業作物に対して耐性を示す可能性がある。本発明の化合物は、遺伝子組換えまたは交配により除草剤に対する耐性が組み込まれ、無脊椎動物有害生物に対して有害なタンパク質(バチルス・チューリングンシス(*Bacillus thuringiensis*)毒素など)を発現する、および／または、他の有用な形質を発現する作物に使用することができる。当業者であれば、すべての化合物がすべての雑草に対して等しく効果的なわけではないことを認識できるであろう。または、主題化合物は、植物の成長を改変するために有用である。

【0239】

本発明の化合物は、望ましくない植生を防除するために、植生を殺滅もしくは損傷させる、またはその生育を減少させることによる(発芽前および発芽後両方の除草性)活性を有するので、本化合物は、除草性有効量の本発明の化合物または前記化合物を含む組成物と界面活性剤、固体希釈剤もしくは液体希釈剤のうちの少なくとも1つとを望ましくない植生の群葉もしくは他の部分と、または例えばその中で望ましくない植生が生育する、または望ましくない植生の種子もしくは珠芽を取り囲む土壤もしくは水などの望ましくない植生の環境と接触させる工程を含む、多種多様な方法によって有効に適用することができる。

【0240】

本発明の化合物の除草性有効量は、多数の因子によって決定される。これらの因子には：選択された製剤、適用方法、存在する植生の量およびタイプ、生育条件などが含まれる。一般に、本発明の化合物の除草性有効量は、約0.001～20kg/haであり、好み範囲は約0.004～1kg/haである。当業者であれば、所望される雑草防除レベルに必要な除草性有効量を容易に決定することができる。

【0241】

1つの共通実施形態において、本発明の化合物は、それらの両方が種子、実生および／またはより大きな植物であってよい所望の植生(例えば、作物)および望ましくない植生(すなわち、雑草)を含む場所に、成長培地(例えば、土壤)と接触させて、典型的には処方組成物中に適用される。この場所では、本発明の化合物を含む組成物は、特に望ましくない植生の植物もしくはその一部に、および／または、その植物と接触している成長培地に直接的に適用することができる。

【0242】

本発明の化合物で処理される場所における所望の植生の植物品種および栽培品種は、従来の繁殖および交配方法によって、または遺伝子組換え法によって得ることができる。遺伝子組換え植物(トランスジェニック植物)は、異種遺伝子(導入遺伝子)が植物のゲノム内に安定的に組み込まれている植物である。植物ゲノム内の特定の位置によって定義される導入遺伝子は、形質転換または遺伝子組み換え事象と呼ばれる。

【0243】

本発明にしたがって処理できる場所における遺伝子組換え植物栽培品種には、1種以上の生物ストレス(例えば、線虫、昆虫、ダニ、真菌などの有害生物)もしくは非生物ストレス(干ばつ、低温、土壤塩分など)に対して耐性である、または他の望ましい特徴を有する品種が含まれる。植物は、例えば、除草剤耐性、昆虫抵抗性、変性油プロファイルまたは干ばつ耐性といった形質を示すように遺伝子組換えすることができる。単一の遺伝子形質転換事象または形質転換事象の組み合わせを含む有用な遺伝子操作組換え植物は、明細表Cに列挙した。明細表Cに列挙した遺伝子組換えについての追加の情報は、例えば米

10

20

30

40

50

国農務省によって管理されている公衆が利用可能なデータベースから入手できる。

【0244】

以下の略語 T 1 ~ T 37 は、形質に関する明細表 C において使用されている。「-」はその項目は適用がないことを意味し、「tol.」は耐性を意味し、「res.」は抵抗性を意味する。

【0245】

【表16】

形質	説明	形質	説明	形質	説明	
T1	グリホサートtol.	T15	低温tol.	T27	高トリプトファン	10
T2	高ラウリン酸油	T16	イミダゾリン系除草剤tol.	T28	半矮性直生群葉	
T3	グルホシネートtol.	T17	α -アミラーゼ改変	T29	半矮性	
T4	フィチン酸塩分解	T18	授粉制御	T30	低鉄分tol.	
T5	オキシニルtol.	T19	2,4-D tol.	T31	変性油/脂肪酸	
T6	病害res.	T20	リシン増加	T32	HPPD tol.	
T7	昆虫res.	T21	干ばつtol.	T33	油分が多い	
T9	花色改変	T22	成熟/老化の遅延	T34	アリールオキシアルカノエートtol.	
T11	ALS系除草剤tol.	T23	生成物品質の改変	T35	メソトリオンtol.	
T12	ジカンバtol.	T24	高セルロース	T36	ニコチン減少	
T13	抗アレルギー	T25	改変デンプン/炭水化物	T37	改変生成物	20
T14	塩tol.	T26	昆虫&病害resist.			

【0246】

【表17】

明細表 C				
作物	事象名	事象コード	形質	遺伝子名
アルファルファ	J101	MON-00101-8	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
アルファルファ	J163	MON-00163-7	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
カノーラ*	23-18-17(事象18)	CGN-89465-2	T2	te
カノーラ*	23-198(事象23)	CGN-89465-2	T2	te
カノーラ*	61061	DP-061061-7	T1	gat4621
カノーラ*	73496	DP-073496-4	T1	gat4621
カノーラ*	GT200(RT200)	MON-89249-2	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
カノーラ*	GT73(RT73)	MON-00073-7	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
カノーラ*	HCN10(Topas 19/2)	-	T3	bar
カノーラ*	HCN28(T45)	ACS-BN008-2	T3	pat(syn)
カノーラ*	HCN92(Topas 19/2)	ACS-BN007-1	T3	bar

40

【0247】

【表 1 8】

カノーラ*	MON88302	MON-88302-9	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
カノーラ*	MPS961	-	T4	phyA	
カノーラ*	MPS962	-	T4	phyA	
カノーラ*	MPS963	-	T4	phyA	
カノーラ*	MPS964	-	T4	phyA	
カノーラ*	MPS965	-	T4	phyA	
カノーラ*	MS1 (B91-4)	ACS-BN004-7	T3	bar	10
カノーラ*	MS8	ACS-BN005-8	T3	bar	
カノーラ*	OXY-235	ACS-BN011-5	T5	bxn	
カノーラ*	PHY14	-	T3	bar	
カノーラ*	PHY23	-	T3	bar	
カノーラ*	PHY35	-	T3	bar	
カノーラ*	PHY36	-	T3	bar	
カノーラ*	RF1 (B93-101)	ACS-BN001-4	T3	bar	
カノーラ*	RF2 (B94-2)	ACS-BN002-5	T3	bar	20
カノーラ*	RF3	ACS-BN003-6	T3	bar	
マメ	EMBRAPA 5.1	EMB-PV051-1	T6	ac1 (センス&アンチセンス)	
アフリカナス#	EE-1	-	T7	cry1Ac	
綿	19-51a	DD-Ø1951A-7	T11	S4-HrA	
綿	281-24-236	DAS-24236-5	T3,T7	pat (syn); cry1F	
綿	3006-210-23	DAS-21023-5	T3,T7	pat (syn); cry1Ac	
綿	31707	-	T5,T7	bxn; cry1Ac	
綿	31803	-	T5,T7	bxn; cry1Ac	
綿	31807	-	T5,T7	bxn; cry1Ac	
綿	31808	-	T5,T7	bxn; cry1Ac	30
綿	42317	-	T5,T7	bxn; cry1Ac	
綿	BNLA-601	-	T7	cry1Ac	
綿	BXN10211	BXN10211-9	T5	bxn; cry1Ac	
綿	BXN10215	BXN10215-4	T5	bxn; cry1Ac	
綿	BXN10222	BXN10222-2	T5	bxn; cry1Ac	
綿	BXN10224	BXN10224-4	T5	bxn; cry1Ac	
綿	COT102	SYN-IR102-7	T7	vip3A(a)	
綿	COT67B	SYN-IR67B-1	T7	cry1Ab	
綿	COT202	-	T7	vip3A	
綿	事象 1	-	T7	cry1Ac	
綿	GMF Cry1A	GTL-GMF311-7	T7	cry1Ab-Ac	40
綿	GHB119	BCS-GH005-8	T7	cry2Ae	
綿	GHB614	BCS-GH002-5	T1	2mepsps	

【 0 2 4 8 】

【表 1 9】

綿	GK12	-	T7	cry1Ab-Ac
綿	LLCotton25	ACS-GH001-3	T3	bar
綿	MLS 9124	-	T7	cry1C
綿	MON1076	MON-89924-2	T7	cry1Ac
綿	MON1445	MON-01445-2	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
綿	MON15985	MON-15985-7	T7	cry1Ac; cry2Ab2
綿	MON1698	MON-89383-1	T7	cp4 epsps (aroA:CP4)
綿	MON531	MON-00531-6	T7	cry1Ac
綿	MON757	MON-00757-7	T7	cry1Ac
綿	MON88913	MON-88913-8	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
綿	Nqwe Chi 6 Bt	-	T7	-
綿	SKG321	-	T7	cry1A; CpTI
綿	T303-3	BCS-GH003-6	T3,T7	cry1Ab; bar
綿	T304-40	BCS-GH004-7	T3,T7	cry1Ab; bar
綿	CE43-67B	-	T7	cry1Ab
綿	CE46-02A	-	T7	cry1Ab
綿	CE44-69D	-	T7	cry1Ab
綿	1143-14A	-	T7	cry1Ab
綿	1143-51B	-	T7	cry1Ab
綿	T342-142	-	T7	cry1Ab
綿	PV-GHGT07 (1445)	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)
綿	EE-GH3	-	T1	mepsps
綿	EE-GH5	-	T7	cry1Ab
綿	MON88701	MON-88701-3	T3,T12	改变 dmo; bar
綿	OsCr11	-	T13	改变 Cry j
亜麻	FP967	CDC-FL001-2	T11	als
レンズマメ	RH44	-	T16	als
トウモロコシ	3272	SYN-E3272-5	T17	amy797E
トウモロコシ	5307	SYN-05307-1	T7	ecry3.1Ab
トウモロコシ	59122	DAS-59122-7	T3,T7	cry34Ab1; cry35Ab1; pat
トウモロコシ	676	PH-000676-7	T3,T18	pat; dam
トウモロコシ	678	PH-000678-9	T3,T18	pat; dam
トウモロコシ	680	PH-000680-2	T3,T18	pat; dam
トウモロコシ	98140	DP-098140-6	T1,T11	gat4621; zm-hra
トウモロコシ	Bt10	-	T3,T7	cry1Ab; pat
トウモロコシ	Bt176 (176)	SYN-EV176-9	T3,T7	cry1Ab; bar
トウモロコシ	BVLA430101	-	T4	phyA2
トウモロコシ	CBH-351	ACS-ZM004-3	T3,T7	cry9C; bar
トウモロコシ	DAS40278-9	DAS40278-9	T19	aad-1
トウモロコシ	DBT418	DKB-89614-9	T3,T7	cry1Ac; pinII; bar
トウモロコシ	DLL25 (B16)	DKB-89790-5	T3	bar

10

20

30

40

【 0 2 4 9 】

【表20】

トウモロコシ	GA21	MON-00021-9	T1	mepsp	
トウモロコシ	GG25	-	T1	mepsp	
トウモロコシ	GJ11	-	T1	mepsp	
トウモロコシ	FI117	-	T1	mepsp	
トウモロコシ	GAT-ZM1	-	T3	pat	
トウモロコシ	LY038	REN-00038-3	T20	cordapA	
トウモロコシ	MIR162	SYN-IR162-4	T7	vip3Aa20	
トウモロコシ	MIR604	SYN-IR604-5	T7	mcry3A	
トウモロコシ	MON801 (MON80100)	MON801	T1,T7	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	10
トウモロコシ	MON802	MON-80200-7	T1,T7	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON809	PH-MON-809-2	T1,T7	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON810	MON-00810-6	T1,T7	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON832	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
トウモロコシ	MON863	MON-00863-5	T7	cry3Bb1	
トウモロコシ	MON87427	MON-87427-7	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
トウモロコシ	MON87460	MON-87460-4	T21	cspB	
トウモロコシ	MON88017	MON-88017-3	T1,T7	cry3Bb1; cp4 epsps (aroA:CP4)	
トウモロコシ	MON89034	MON-89034-3	T7	cry2Ab2; cry1A.105	20
トウモロコシ	MS3	ACS-ZM001-9	T3,T18	bar; barnase	
トウモロコシ	MS6	ACS-ZM005-4	T3,T18	bar; barnase	
トウモロコシ	NK603	MON-00603-6	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
トウモロコシ	T14	ACS-ZM002-1	T3	pat (syn)	
トウモロコシ	T25	ACS-ZM003-2	T3	pat (syn)	
トウモロコシ	TC1507	DAS-01507-1	T3,T7	cry1Fa2; pat	
トウモロコシ	TC6275	DAS-06275-8	T3,T7	mocry1F; bar	
トウモロコシ	VIP1034	-	T3,T7	vip3A; pat	
トウモロコシ	43A47	DP-043A47-3	T3,T7	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat	
トウモロコシ	40416	DP-040416-8	T3,T7	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat	
トウモロコシ	32316	DP-032316-8	T3,T7	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat	
トウモロコシ	4114	DP-004114-3	T3,T7	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat	30
メロン	Melon A	-	T22	sam-k	
メロン	Melon B	-	T22	sam-k	
パパイヤ	55-1	CUH-CP551-8	T6	prsv cp	
パパイヤ	63-1	CUH-CP631-7	T6	prsv cp	
パパイヤ	Huanong No. 1	-	T6	prsv rep	
パパイヤ	X17-2	UFL-X17CP-6	T6	prsv cp	
プラム	C-5	ARS-PLMC5-6	T6	ppv cp	
カノーラ**	ZSR500	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
カノーラ**	ZSR502	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	

【0250】

【表 2 1】

カノーラ**	ZSR503	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
イネ	7Crp#242-95-7	-	T13	7crp	
イネ	7Crp#10	-	T13	7crp	
イネ	GM Shanyou 63	-	T7	cry1Ab; cry1Ac	
イネ	Huahui-1/TT51-1	-	T7	cry1Ab; cry1Ac	
イネ	LLRICE06	ACS-OS001-4	T3	bar	
イネ	LLRICE601	BCS-OS003-7	T3	bar	
イネ	LLRICE62	ACS-OS002-5	T3	bar	
イネ	Tarom molaii + cry1Ab	-	T7	cry1Ab (切断)	10
イネ	GAT-OS2	-	T3	bar	
イネ	GAT-OS3	-	T3	bar	
イネ	PE-7	-	T7	Cry1Ac	
イネ	7Crp#10	-	T13	7crp	
イネ	KPD627-8	-	T27	OASA1D	
イネ	KPD722-4	-	T27	OASA1D	
イネ	KA317	-	T27	OASA1D	
イネ	HW5	-	T27	OASA1D	
イネ	HW1	-	T27	OASA1D	
イネ	B-4-1-18	-	T28	△ OsBRI1	
イネ	G-3-3-22	-	T29	OSGA2ox1	20
イネ	AD77	-	T6	DEF	
イネ	AD51	-	T6	DEF	
イネ	AD48	-	T6	DEF	
イネ	AD41	-	T6	DEF	
イネ	13pNasNa800725atAprt1	-	T30	HvNAS1; HvNAAT-A; APRT	
イネ	13pAprt1	-	T30	APRT	
イネ	gHvNAS1-gHvNAAT-1	-	T30	HvNAS1; HvNAAT-A; HvNAAT-B	
イネ	gHvIDS3-1	-	T30	HvIDS3	
イネ	gHvNAAT1	-	T30	HvNAAT-A; HvNAAT-B	
イネ	gHvNAS1-1	-	T30	HvNAS1	
イネ	NIA-OS006-4	-	T6	WRKY45	30
イネ	NIA-OS005-3	-	T6	WRKY45	
イネ	NIA-OS004-2	-	T6	WRKY45	
イネ	NIA-OS003-1	-	T6	WRKY45	
イネ	NIA-OS002-9	-	T6	WRKY45	
イネ	NIA-OS001-8	-	T6	WRKY45	
イネ	OsCr11	-	T13	改变 Cry j	
イネ	17053	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
イネ	17314	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
バラ	WKS82 / 130-4-1	IFD-52401-4	T9	5AT; bp40 (f3'5'h)	
バラ	WKS92 / 130-9-1	IFD-52901-9	T9	5AT; bp40 (f3'5'h)	40

【 0 2 5 1 】

【表22】

ダイズ	260-05 (G94-1, G94-19, G168)	-	T9	gm-fad2-1 (サイレンシング遺伝子座)	
ダイズ	A2704-12	ACS-GM005-3	T3	pat	
ダイズ	A2704-21	ACS-GM004-2	T3	pat	
ダイズ	A5547-127	ACS-GM006-4	T3	pat	
ダイズ	A5547-35	ACS-GM008-6	T3	pat	
ダイズ	CV127	BPS-CV127-9	T16	csr1-2	10
ダイズ	DAS68416-4	DAS68416-4	T3	pat	
ダイズ	DP305423	DP-305423-1	T11,T31	gm-fad2-1 (サイレンシング遺伝子座); gm-hra	
ダイズ	DP356043	DP-356043-5	T1,T31	gm-fad2-1 (サイレンシング遺伝子座); gat4601	
ダイズ	FG72	MST-FG072-3	T32,T1	2mepsps; hppdPF W336	
ダイズ	GTS 40-3-2 (40-3-2)	MON-04032-6	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
ダイズ	GU262	ACS-GM003-1	T3	pat	
ダイズ	MON87701	MON-87701-2	T7	cry1Ac	
ダイズ	MON87705	MON-87705-6	T1,T31	fatb1-A (センス&アンチセンス); fad2-1A (センス&アンチセンス); cp4 epsps (aroA:CP4)	20
ダイズ	MON87708	MON-87708-9	T1,T12	dmo; cp4 epsps (aroA:CP4)	
ダイズ	MON87769	MON-87769-7	T1,T31	Pj.D6D; Nc.Fad3; cp4 epsps (aroA:CP4)	
ダイズ	MON89788	MON-89788-1	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
ダイズ	W62	ACS-GM002-9	T3	bar	
ダイズ	W98	ACS-GM001-8	T3	bar	
ダイズ	MON87754	MON-87754-1	T33	dgat2A	
ダイズ	DAS21606	DAS-21606	T34,T3	改变 aad-12; pat	
ダイズ	DAS44406	DAS-44406-6	T1,T3,T34	改变 aad-12; 2mepsps; pat	
ダイズ	SYHT04R	SYN-0004R-8	T35	改变 avhppd	
ダイズ	9582.814.19.1	-	T3,T7	cry1Ac, cry1F, PAT	30
カボチャ	CZW3	SEM-ØCZW3-2	T6	cmv cp, zymv cp, wmv cp	
カボチャ	ZW20	SEM-0ZW20-7	T6	zymv cp, wmv cp	
サトウダイコン	GTSB77 (T9100152)	SY-GTSB77-8	T1	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247	
サトウダイコン	H7-1	KM-000H71-4	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
サトウダイコン	T120-7	ACS-BV001-3	T3	pat	
サトウダイコン	T227-1	-	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)	
サトウキビ	NXI-1T	-	T21	EcbetA	
ヒマワリ	X81359	-	T16	als	
コショウ	PK-SP01	-	T6	cmv cp	40
タバコ	C/F/93/08-02	-	T5	bxn	
タバコ	Vector 21-41	-	T36	NtQPT1 (アンチセンス)	

【0252】

【表23】

ヒマワリ	X81359	-	T16	als
コムギ	MON71800	MON-71800-3	T1	cp4 epsps (aroA:CP4)

* アルゼンチン(ブラシカ・ナプス(*Brassica napus*)), ** ポーランド(*B.ラバ(B. rapa)*), # ナス

【0253】

最も典型的には、本発明の化合物は望ましくない植生を防除するために使用されるが、処理された場所における所望される植生と本発明の化合物との接触は、遺伝子組換えを介して組み込まれた形質を含む所望の植生における遺伝形質との超相加的または相乗作用的効果を生じさせる可能性がある。例えば、植食性害虫もしくは植物病害に対する抵抗性、生物ストレス／非生物ストレスに対する耐性または貯蔵安定性は、所望の植生における遺伝形質から予想されるものより大きい場合がある。

【0254】

本発明の化合物はまた、いっそう広範囲の農業保護を生じさせる多成分殺虫剤を形成するため、除草剤、除草剤毒性緩和剤、殺真菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、殺菌剤、殺ダニ剤、例えば昆虫脱皮阻害剤および発根刺激剤などの成長調節剤、不妊化剤、信号化学物質、忌避剤、誘引剤、フェロモン、摂食刺激物質、植物栄養分、他の生物学的活性化合物または昆虫病原性細菌、ウイルスもしくは真菌を含む1種以上の他の生物学的活性化合物もしくは作用物質と混合することができる。本発明の化合物と他の除草剤との混合物は、追加の雑草種に対する活性範囲を拡大し、任意の抵抗性バイオタイプの増殖を抑制することができる。したがって、本発明はさらに、(除草性有効量の)式1の化合物と、少なくとも1つの(生物学的有効量の)追加の生物学的活性化合物もしくは作用物質とを含む組成物であって、さらに界面活性剤、固体希釈剤または液体希釈剤のうちの少なくとも1つを含むことができる組成物に関する。他の生物学的活性化合物もしくは作用物質もまた、界面活性剤、固体または液体希釈剤のうちの少なくとも1つを含む組成物中に処方することができる。本発明の混合物のためには、プレミックスを形成するために1つ以上の他の生物学的活性化合物もしくは作用物質は、式1の化合物と一緒に処方することができる、または1つ以上の他の生物学的活性化合物もしくは作用物質は、式1の化合物とは別個に処方し、および製剤を適用前に一緒に(例えば、スプレー・タンク内で)結合する、または連続して適用することができる。

【0255】

1種以上の以下の除草剤と本発明の化合物との混合物は、雑草防除に特に有用な可能性がある:アセトクロール、アシフルオルフェンおよびそのナトリウム塩、アクロニフェン、アクロレイン(2-プロペナール)、アラクロール、アロキシジム、アメトリン、アミカルバゾン、アミドスルフロン、アミノシクロピラクロルおよびそのエステル(例えば、メチル、エチル)および塩(例えば、ナトリウム、カリウム)、アミノピラリド、アミトロール、スルファミン酸アンモニウム、アニロホス、アスマム、アトラジン、アジムスルフロン、ベフルブタミド、ベナゾリン、ベナゾリン-エチル、ベンカルバゾン、ベンフルラリン、ベンフレセート、ベンスルフロン-メチル、ベンスリド、ベンタゾン、ベンゾビシクロロン、ベンゾフェナップ、ビシクロピロン、ビフェノックス、ビラナホス、ビスピリバックおよびそのナトリウム塩、ブロマシル、ブロモブチド、ブロモフェノキシム、ブロモキシニル、オクタン酸ブロモキシニル、ブタクロール、ブタフェナシル、ブタミホス、ブトラリン、ブトロキシジム、ブチレート、カフェンストロール、カルベタミド、カルフェントラゾン-エチル、カテキン、クロメトキシフェン、クロラムベン、クロルプロムロン、クロルフルレノール-メチル、クロリダゾン、クロリムロン-エチル、クロロトルロン、クロルプロファム、クロルスルフロン、クロルタール-ジメチル、クロルチアミド、シニドン-エチル、シンメチリン、シノスルフロン、クラシホス、クレホキシジム、クレトジム、クロジナホップ-ブロバルギル、クロマゾン、クロメプロップ、クロピラリド、クロピラリド-オラミン、クロランスラム-メチル、クミルロン、シアナジン、シクロエート、シクロピリモレート、シクロスルファムロン、シクロキシジム、シハロホップ-ブチル、2,4-Dおよびそのブトチル、ブチル、イソオクチルおよびイソプロピルエステルおよびそのジメチルアンモニウム、ジオラミンおよびトロールアミン塩、ダイムロン、ダラポン、ダラポン-ナトリウム、ダゾメット、2,4-DBおよびそのジメチルアンモニウム、カリウムおよびナトリウム塩、デスマディファム、デスマトリン、ジカンバおよびそのジグリコールアンモニウム、ジメチルアンモニウム、カリウムおよびナトリウム塩

10

20

30

40

50

、ジクロベニル、ジクロルプロップ、ジクロホップ - メチル、ジクロスラム、ジフェンゾコートメチル硫酸塩、ジフルヘニカン、ジフルフェンゾピル、ジメフロン、ジメピペレート、ジメタクロール、ジメタトリン、ジメテナミド、ジメテナミド - P、ジメチピン、ジメチルアルシン酸およびそのナトリウム塩、ジニトロアミン、ジノテルブ、ジフェナミド、ダイコートジブロミド、ジチオピル、ジウロン、D N O C、エンドタール、E P T C、エスプロカルブ、エタルフルラリン、エタメツルフロン - メチル、エチオジン、エトメセート、エトキシフェン、エトキシスルフロン、エトベンザニド、フェノキサプロップ - エチル、フェノキサプロップ - P - エチル、フェノキサスルホン、フェンキノトリオン、フェントラザミド、フェヌロン、フェヌロン - T C A、フラムプロップ - メチル、フラムプロップ - M - イソプロビル、フラムプロップ - M - メチル、フラザスルフロン、フロラスラム、フルアジホップ - ブチル、フルアジホップ - P - ブチル、フルアゾレート、フルカルバゾン、フルセトスルフロン、フルクロラリン、フルフェナセット、フルフェンピル、フルフェンピル - エチル、フルメツラム、フルミクロラック - ペンチル、フルミオキサジン、フルオメツロン、フルオログリコフェン - エチル、フルポキサム、フルピルスルフロン - メチルおよびそのナトリウム塩、フルレノール、フルレノール - ブチル、フルリドン、フルロクロリドン、フルロキシピル、フルルタモン、フルチアセット - メチル、ホメサフェン、ホラムスルフロン、ホサミン - アンモニウム、グルホシネット、グルホシネート - アンモニウム、グルホシネット - P、グリホサートおよび例えはアンモニウム、イソプロピルアンモニウム、カリウム、ナトリウム(セスキナトリウム塩を含む)およびトリメシウム塩(または、スルホサートと呼ばれる)などのその塩、ハラウキシフェン、ハラウキシフェン - メチル、ハロスルフロン - メチル、ハロキシホップ - エトチル、ハロキシホップ - メチル、ヘキサジノン、ヒダントシジン、イマザメタベンズ - メチル、イマザモックス、イマザピック、イマザピル、イマザキン、イマザキン - アンモニウム、イマゼタピル、イマゼタピル - アンモニウム、イマゾスルフロン、インダノファン、インダジフラム、イオフェンスルフロン、ヨードスルフロン - メチル、イオキシニル、イオキシニルオクタノエート、イオキシニル - ナトリウム、イプフェンカルバゾン、イソプロツロン、イソウロン、イソキサベン、イソキサフルトール、イソキサクロルトール、ラクトフェン、レナシル、リニュロン、マレイン酸ヒドラジド、M C P A およびその塩(例えは、M C P A - ジメチルアンモニウム、M C P A - カリウムおよびM C P A - ナトリウム、エステル(例えは、M C P A - 2 - エチルヘキシル、M C P A - ブトチル)およびチオエステル(例えは、M C P A - チオエチル)、M C P B およびその塩(例えは、M C P B - ナトリウム)およびエステル(例えは、M C P B - エチル)、メコプロップ、メコプロップ - P、メフェナセット、メフルイジド、メソスルフロン - メチル、メソトリオン、メタム - ナトリウム、メタミホブ、メタミトロン、メタザクロール、メタゾスルフロン、メタベンズチアズロン、メチルアルソン酸およびそのカルシウム、モノアンモニウム、モノナトリウムおよびジナトリウム塩、メチルダイムロン、メトベンズロン、メトプロムロン、メトラクロール、S - メトラクロール、メトラム、メトキスロン、メトリブジン、メトスルフロン - メチル、モリネット、モノリニュロン、ナプロアニリド、ナプロパミド、ナプロパミド - M、ナブタラム、ネブロン、ニコスルフロン、ノルフラゾン、オルベンカルブ、オルトスルファムロン、オリザリン、オキサジアルギル、オキサジアゾン、オキサスルフロン、オキサジクロメホン、オキシフルオルフェン、パラコートジクロリド、ペブレート、ペラルゴン酸、ペンディメタリン、ペノキスラム、ペンタノクロール、ペントキサゾン、ペルフルイドン、ペトソキサミド、ペトキシアミド、フェンメディファム、ピクロラム、ピクロラム - カリウム、ピコリナフェン、ピノキサデン、ピペロホス、プレチラクロール、プリミスルフロン - メチル、プロジアミン、プロホキシジム、プロメトン、プロメトリン、プロパクロール、プロパニル、プロパキザホップ、プロパジン、プロファム、プロピソクロール、プロポキシカルバゾン、プロピリスルフロン、プロピザミド、プロスルホカルブ、プロスルフロン、ピラクロニル、ピラフルフェン - エチル、ピラスルホトール、ピラゾギル、ピラゾリネット、ピラゾキシフェン、ピラゾスルフロン - エチル、ピリベンゾキシム、ピリブチカルブ、ピリデート、ピリフタリド、ピリミノバック - メチル、ピリミ
10
20
30
40
50

スルファン、ピリチオバック、ピリチオバック - ナトリウム、ピロキサスルホン、ピロキシスラム、キンクロラック、キンメラック、キノクラミン、キザロホップ - エチル、キザロホップ - P - エチル、キザロホップ - P - テフリル、リムスルフロン、サフルフェナシル、セトキシジム、シズロン、シマジン、シメトリン、スルコトリオン、スルフェントラゾン、スルホメツロン - メチル、スルホスルフロン、2,3,6-TBA、TCA、TCA - ナトリウム、テブタム、テブチウロン、テフリルトリオン、テンボトリオン、テプラロキシジム、ターバシル、テルブメトン、テルブチラジン、テルブトリン、テニルクロール、チアゾビル、チエンカルバゾン、チフェンスルフロン - メチル、チオベンカルブ、チアフェナシル、チオカルバジル、トルピラレート、トプラメゾン、トラルコキシジム、トリ - アレート、トリアファモネ、トリアスルフロン、トリアジフラム、トリベニュロン - メチル、トリクロビル、トリクロビル - ブトチル、トリクロビル - トリエチルアンモニウム、トリジファン、トリエタジン、トリフロキシスルフロン、トリフルジモキサジン、トリフルラリン、トリフルスルフロン - メチル、トリトルスルフロン、ベルノレート、3-(2-クロロ - 3,6-ジフルオロフェニル) - 4-ヒドロキシ - 1-メチル - 1,5-ナフチリジン - 2(1H)-オン、5-クロロ - 3-[(2-ヒドロキシ - 6-オキソ - 1-シクロヘキセン - 1-イル) カルボニル] - 1-(4-メトキシフェニル) - 2(1H) - キノキサリノン、2-クロロ - N-(1-メチル - 1H - テトラゾール - 5-イル) - 6-(トリフルオロメチル) - 3-ピリジンカルボキサミド、7-(3,5-ジクロロ - 4-ピリジニル) - 5-(2,2-ジフルオロエチル) - 8-ヒドロキシピリド [2,3-b]ピラジン - 6(5H) - オン)、4-(2,6-ジエチル - 4-メチルフェニル) - 5-ヒドロキシ - 2,6-ジメチル - 3(2H) - ピリダジノン)、5-[[(2,6-ジフルオロフェニル)メトキシ]メチル] - 4,5-ジヒドロ - 5-メチル - 3-(3-メチル - 2-チエニル)イソオキサゾール(旧名メチオキソリン)、4-(4-(フルオロフェニル) - 6-[(2-ヒドロキシ - 6-オキソ - 1-シクロヘキセン - 1-イル) カルボニル] - 2-メチル - 1,2,4-トリアジン - 3,5-(2H,4H) - ジオン、メチル4-アミノ - 3-クロロ - 6-(4-クロロ - 2-フルオロ - 3-メトキシフェニル) - 5-フルオロ - 2-ピリジンカルボキシレート、2-メチル - 3-(メチルスルホニル) - N-(1-メチル - 1H - テトラゾール - 5-イル) - 4-(トリフルオロメチル)ベンズアミドおよび2-メチル - N-(4-メチル - 1,2,5-オキサジアゾール - 3-イル) - 3-(メチルスルフィニル) - 4-(トリフルオロメチル)ベンズアミド。他の除草剤にはさらに、例えばアルテルナリア・デストルエンス・シモンズ(*Alternaria destruens Simmons*)、コレトトリカム・グロエオスポリオデス(*Colletotrichum gloeosporioides*(Penz.)Penz.& Sacc.)、ドレキシエラ・モノセラス(*Drechslera monoceras*) (MTB-951)、ミロテシウム・ベルカリア(*Myrothecium verrucaria*(Albertini & Schweinitz)Ditmar:Fries)、フィトフトラ・パルミボラ(*Phytophthora palmivora*(Butl.)Butl.)およびブッチャニア・ツラスペオス・シユーブ(*Puccinia thlaspeos Schub*)などの生物除草剤が含まれる。

【0256】

本発明の化合物はさらに、例えばアビグリシン、N-(フェニルメチル) - 1H - プリン - 6-アミン、エポコレオン、ジベレリン酸、ジベレリンA₄およびA₇、ハーピンタンパク質、塩化メピコート、プロヘキサジオンカルシウム、プロヒドロジャスモン、ニトロフェノレートナトリウムおよびトリネキサパック - メチルならびに例えばバチルス・セレウス(*Bacillus cereus*)菌株B P 0 1などの植物の成長を改変する生物などの植物成長調節物質と組み合わせて使用することもできる。

【0257】

農業保護剤(すなわち、除草剤、除草剤毒性緩和剤、殺虫剤、殺真菌剤、殺線虫剤、殺ダニ剤および生物学的作用物質)に関する一般的な文献には、The Pesticid

10

20

30

40

50

e Manual, 13th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003およびThe Biopesticide Manual, 2nd Edition, L.G. Coppings, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001が含まれる。

【0258】

これらの種々の混合相手の1つ以上が使用される実施形態については、混合相手は、典型的には混合相手が単独で使用される場合に慣習的な量に類似する量で使用される。特に混合物中では、有効成分は、有効成分を単独で使用するために製品ラベル上に明記された半散布量と全散布量との間の散布量で適用されることが多い。これらの量は、例えばThe Pesticide ManualおよびThe Biopesticide Manualなどの文献に列挙されている。これらの様々な混合相手（総計で）対式1の化合物の重量比は、典型的には約1:3,000～約3,000:1である。注目すべきは、約1:300～約300:1の重量比（例えば、約1:30～約30:1の比）である。当業者であれば、所望の範囲の生物学的活性に必要とされる有効成分の生物学的有効量を単純な実験を通して容易に決定することができよう。これらの追加の構成成分を包含することが、防除される雑草の範囲を式1の化合物単独で防除される範囲を超えて拡大できることは明らかであろう。

【0259】

所定の例では、本発明の化合物と他の生物学的に活性な（特に除草性の）化合物または作用物質（すなわち、有効成分）との組み合わせは、雑草に対して相加的を上回る（すなわち相乗的）効果をもたらす、および／または、作物もしくは他の望ましい植物に対して相加的を上回らない（すなわち、毒性緩和）効果を生じさせることができる。効果的な有害虫の防除を保証しながら環境中に放出される有効成分の量を低減させることは、常に望ましい。過剰な作物被害を伴うことなくより効果的な雑草防除を提供するためにより多量の有効成分を使用できる能力もまた望ましい。雑草に対する除草性有効成分の相乗作用が農業経済学的に満足できるレベルの雑草防除をもたらす散布量で発生する場合、そのような組み合わせは、作物生産コストの削減および環境負荷の低減に有利な可能性がある。作物への除草性有効成分の毒性緩和が発生する場合、そのような組み合わせは、雑草競合を減少させることによって作物保護を増加させるために有利な可能性がある。

【0260】

注目すべきは、本発明の化合物と少なくとも1つの他の除草性有効成分との組み合わせである。特に注目すべきは、他の除草性有効成分が本発明の化合物とは異なる作用部位を有するような組み合わせである。所定の例では、類似の防除範囲を有するが作用部位が異なる少なくとも1つの他の除草性有効成分との組み合わせが、抵抗性管理にとって特に有利であろう。したがって、本発明の組成物はさらに、類似の防除範囲を有するが作用部位が異なる少なくとも1つの追加の除草性有効成分を（除草性有効量で）含むことができる。

【0261】

本発明の化合物はさらに、所定の作物にとっての安全性を高めるために、例えばアリドクロル、ベノキサコール、クロキントセット-メキシル、クミルロン、シオメトリニル、シプロスルホンアミド、ダイムロン、ジクロルミド、ジシクロノン、ジエトレーント、ジメピペレート、フェンクロラゾール-エチル、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン-エチル、メフェンピル-ジエチル、メフェネート、メトキシフェノンナフタル酸無水物（1,8-ナフタル酸無水物）、オキサベトリニル、N-（アミノカルボニル）-2-メチルベンゼンスルホンアミド、N-（アミノカルボニル）-2-フルオロベンゼンスルホンアミド、1-ブロモ-4-[（クロロメチル）スルホニル]-ベンゼン（BCS）、4-（ジクロロアセチル）-1-オキサ-4-アズスピロ[4.5]デカン（MON4660）、2-（ジクロロメチル）-2-メチル-

10

20

30

40

50

1 , 3 - ジオキソラン (MG 191) 、エチル 1 , 6 - ジヒドロ - 1 - (2 - メトキシフェニル) - 6 - オキソ - 2 - フェニル - 5 - ピリミジンカルボキシレート、2 - ヒドロキシ - N , N - ジメチル - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - カルボキサミドならびに 3 - オキソ - 1 - シクロヘキセン - 1 - イル 1 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 1 , 6 - ジヒドロ - 6 - オキソ - 2 - フェニル - 5 - ピリミジンカルボキシレート、2 , 2 - ジクロロ - 1 - (2 , 2 , 5 - トリメチル - 3 - オキサゾリジニル) - エタノンおよび 2 - メトキシ - N - [[4 - [[(メチルアミノ) カルボニル] アミノ] フェニル] スルホニル] - ベンズアミドなどの除草剤毒性緩和剤と組み合わせて使用することができる。解毒性有効量の除草剤毒性緩和剤は、本発明の化合物と同時に適用できる、または種子処理として適用できる。このため本発明の態様は、本発明の化合物および解毒性有効量の除草剤毒性緩和剤を含む除草剤混合物に関する。種子処理は、それが解毒を作物植物に限定するので、選択的な雑草防除にとって特に有用である。このため、本発明の特に有用な実施形態は、作物における望ましくない植生の成長を選択的に防除する方法であって、作物の場所を除草性有効量の本発明の化合物と接触させる工程を含み、このときそれから作物が成長する種子が解毒性有効量の毒性緩和剤を用いて処理される方法である。毒性緩和剤の解毒性有効量は、当業者であれば単純な実験を通して容易に決定できよう。

【 0262 】

本発明の化合物は、さらに：(1) 除草性効果をもたらす遺伝子由来転写のダウンレギュレーション、干渉、抑制もしくはサイレンシングを通して特定標的の量に影響を及ぼす DNA 、 RNA および / または化学修飾ヌクレオチドを含むがこれらに限定されないポリヌクレオチド；または(2) 毒性緩和効果をもたらす遺伝子由来転写のダウンレギュレーション、干渉、抑制もしくはサイレンシングを通して特定標的の量に影響を及ぼす DNA 、 RNA および / または化学修飾ヌクレオチドを含むがこれらに限定されないポリヌクレオチドと混合することができる。

【 0263 】

注目すべきは、本発明の（除草性有効量にある）化合物と、他の（有効量にある）除草剤および除草剤毒性緩和剤からなる群から選択される少なくとも 1 つの追加の有効成分と界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 つの構成成分とを含む組成物である。

【 0264 】

望ましくない植生のより良好な防除（例えば、相乗作用などによる使用量の低減、より広範囲の雑草の防除または作物の安全性の強化）のためまたは抵抗性雑草の発生を防止するために好ましいのは、本発明の化合物と他の除草剤との混合物である。表 A 1 は、本発明の混合物、組成物および方法を例示している、構成成分 (a) （すなわち、本発明の特定の化合物）と構成成分 (b) としての他の除草剤との特定の組み合わせを列挙している。構成成分 (a) 欄中の化合物 17 は、索引表 A に特定されている。表 A 1 の第 2 欄には、特定の構成成分 (b) の化合物（例えば、第 1 行における「 2 , 4 - D 」）を列挙した。表 A 1 の第 3 、第 4 および第 5 欄には、屋外栽培作物に典型的に適用される構成成分 (a) 化合物の量対構成成分 (b) の量の重量比（すなわち、(a) : (b) ）の範囲が列挙されている。したがって、例えば、表 A 1 の第 1 行は、構成成分 (a) （すなわち、索引表 A 中の化合物 17 ）と 2 , 4 - D との組み合わせが、典型的には、 1 : 192 ~ 6 : 1 の重量比で適用されることを詳細に開示している。表 A 1 の残りの行は、同様に解釈すべきである。

【 0265 】

10

20

30

40

【表 2 4】

表 A1

<u>構成成分(a)</u> <u>(化合物番号)</u>	<u>構成成分(b)</u>	<u>典型的な</u> <u>重量比</u>	<u>より典型的な</u> <u>重量比</u>	<u>最も典型的な</u> <u>重量比</u>
1	2,4-D	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	アセトクロール	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	アシフルオルフェン	1:96 - 12:1	1:32 - 4:1	1:12 - 1:2
1	アクロニフェン	1:857 - 2:1	1:285 - 1:3	1:107 - 1:12
1	アラクロール	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	アメトリン	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	アミカルバゾン	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	アミドスルフロン	1:6 - 168:1	1:2 - 56:1	1:1 - 11:1
1	アミノシクロピラクロール	1:48 - 24:1	1:16 - 8:1	1:6 - 2:1
1	アミノピラリド	1:20 - 56:1	1:6 - 19:1	1:2 - 4:1
1	アミトロール	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	アニロホス	1:96 - 12:1	1:32 - 4:1	1:12 - 1:2
1	アスラム	1:960 - 2:1	1:320 - 1:3	1:120 - 1:14
1	アトラジン	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	アジムスルフロン	1:6 - 168:1	1:2 - 56:1	1:1 - 11:1
1	ペフルブタミド	1:342 - 4:1	1:114 - 2:1	1:42 - 1:5
1	ベンフレセート	1:617 - 2:1	1:205 - 1:2	1:77 - 1:9
1	ベンスルフロン-メチル	1:25 - 45:1	1:8 - 15:1	1:3 - 3:1
1	ベンタゾン	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	ベンゾビシクロン	1:85 - 14:1	1:28 - 5:1	1:10 - 1:2

10

20

【0 2 6 6】

30

【表 25】

<u>構成成分(a)</u> (化合物番号)	<u>構成成分(b)</u>	<u>典型的な</u> <u>重量比</u>	<u>より典型的な</u> <u>重量比</u>	<u>最も典型的な</u> <u>重量比</u>
1	ベンゾフェナップ	1:257 - 5:1	1:85 - 2:1	1:32 - 1:4
1	ビシクロピロン	1:42 - 27:1	1:14 - 9:1	1:5 - 2:1
1	ビフェノックス	1:257 - 5:1	1:85 - 2:1	1:32 - 1:4
1	ビスピリバック-ナトリウム	1:10 - 112:1	1:3 - 38:1	1:1 - 7:1
1	ブロマシル	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	ブロモブチド	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	ブロモキシニル	1:96 - 12:1	1:32 - 4:1	1:12 - 1:2
1	ブタクロール	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	ブタフェナシル	1:42 - 27:1	1:14 - 9:1	1:5 - 2:1
1	ブチレート	1:1542 - 1:2	1:514 - 1:5	1:192 - 1:22
1	カルフェンストロール	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	カルフェントラゾン-エチル	1:128 - 9:1	1:42 - 3:1	1:16 - 1:2
1	クロリムロン-エチル	1:8 - 135:1	1:2 - 45:1	1:1 - 9:1
1	クロロトルロン	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	クロルスルフロン	1:6 - 168:1	1:2 - 56:1	1:1 - 11:1
1	シンコスルフロン	1:17 - 68:1	1:5 - 23:1	1:2 - 5:1
1	シニドン-エチル	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	シンメチリン	1:34 - 34:1	1:11 - 12:1	1:4 - 3:1
1	クラシホス	1:34 - 34:1	1:11 - 12:1	1:4 - 3:1
1	クレトイド	1:48 - 24:1	1:16 - 8:1	1:6 - 2:1
1	クロジナホップ-プロパルギル	1:20 - 56:1	1:6 - 19:1	1:2 - 4:1
1	クロマゾン	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	クロメプロップ	1:171 - 7:1	1:57 - 3:1	1:21 - 1:3
1	クロピラリド	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	クロランスラム-メチル	1:12 - 96:1	1:4 - 32:1	1:1 - 6:1
1	クミルロン	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	シアナジン	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	シクロピリモレート	1:17 - 68:1	1:5 - 23:1	1:2 - 5:1
1	シクロスルファムロン	1:17 - 68:1	1:5 - 23:1	1:2 - 5:1
1	シクロキシジム	1:96 - 12:1	1:32 - 4:1	1:12 - 1:2
1	シハロホップ	1:25 - 45:1	1:8 - 15:1	1:3 - 3:1
1	ダイムロン	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	デスマディファム	1:322 - 4:1	1:107 - 2:1	1:40 - 1:5
1	ジカンバ	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	ジクロベニル	1:1371 - 1:2	1:457 - 1:4	1:171 - 1:20

【0267】

【表 2 6】

<u>構成成分(a) (化合物番号)</u>	<u>構成成分(b)</u>	<u>典型的な 重量比</u>	<u>より典型的な 重量比</u>	<u>最も典型的な 重量比</u>
1	ジクロルプロップ	1:925 - 2:1	1:308 - 1:3	1:115 - 1:13
1	ジクロホップ-メチル	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	ジクロスラム	1:10 - 112:1	1:3 - 38:1	1:1 - 7:1
1	ジフェンゾコート	1:288 - 4:1	1:96 - 2:1	1:36 - 1:4
1	ジフルフェニカン	1:857 - 2:1	1:285 - 1:3	1:107 - 1:12
1	ジフルフェンゾピル	1:12 - 96:1	1:4 - 32:1	1:1 - 6:1
1	ジメタクロール	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	ジメタメトリン	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	ジメテナミド-P	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	ジチオピル	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	ジウロン	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	EPTC	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	エスプロカルブ	1:1371 - 1:2	1:457 - 1:4	1:171 - 1:20
1	エタルフルラリン	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	エタメツルフロン-メチル	1:17 - 68:1	1:5 - 23:1	1:2 - 5:1
1	エトキシフェン	1:8 - 135:1	1:2 - 45:1	1:1 - 9:1
1	エトキシスルフロン	1:20 - 56:1	1:6 - 19:1	1:2 - 4:1
1	エトベンザニド	1:257 - 5:1	1:85 - 2:1	1:32 - 1:4
1	フェノキサプロップ-エチル	1:120 - 10:1	1:40 - 4:1	1:15 - 1:2
1	フェノキサスルホン	1:85 - 14:1	1:28 - 5:1	1:10 - 1:2
1	フェンキノトリオン	1:17 - 68:1	1:5 - 23:1	1:2 - 5:1
1	フェントラザミド	1:17 - 68:1	1:5 - 23:1	1:2 - 5:1
1	フラザスルフロン	1:17 - 68:1	1:5 - 23:1	1:2 - 5:1
1	フロラスラム	1:2 - 420:1	1:1 - 140:1	2:1 - 27:1
1	フルアジホップ-ブチル	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	フルカルバゾン	1:8 - 135:1	1:2 - 45:1	1:1 - 9:1
1	フルセトスルフロン	1:8 - 135:1	1:2 - 45:1	1:1 - 9:1
1	フルフェナセット	1:257 - 5:1	1:85 - 2:1	1:32 - 1:4
1	フルメツラム	1:24 - 48:1	1:8 - 16:1	1:3 - 3:1
1	フルミクロラック-ペンチル	1:10 - 112:1	1:3 - 38:1	1:1 - 7:1
1	フルミオキサジン	1:25 - 45:1	1:8 - 15:1	1:3 - 3:1
1	フルオメツロン	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	フルピルスルフロン-メチル	1:3 - 336:1	1:1 - 112:1	2:1 - 21:1
1	フルリドン	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	フルロキシピル	1:96 - 12:1	1:32 - 4:1	1:12 - 1:2

【0268】

【表 27】

<u>構成成分(a) (化合物番号)</u>	<u>構成成分(b)</u>	<u>典型的な 重量比</u>	<u>より典型的な 重量比</u>	<u>最も典型的な 重量比</u>
1	フルルタモン	1:857 - 2:1	1:285 - 1:3	1:107 - 1:12
1	フルチアセット-メチル	1:48 - 42:1	1:16 - 14:1	1:3 - 3:1
1	フォメサフェン	1:96 - 12:1	1:32 - 4:1	1:12 - 1:2
1	ホラムスルフロン	1:13 - 84:1	1:4 - 28:1	1:1 - 6:1
1	グルホシネット	1:288 - 4:1	1:96 - 2:1	1:36 - 1:4
1	グリホサート	1:288 - 4:1	1:96 - 2:1	1:36 - 1:4
1	ハロスルフロン-メチル	1:17 - 68:1	1:5 - 23:1	1:2 - 5:1
1	ハラウキシフェン	1:20 - 56:1	1:6 - 19:1	1:2 - 4:1
1	ハラウキシフェン-メチル	1:20 - 56:1	1:6 - 19:1	1:2 - 4:1
1	ハロキシホップ-メチル	1:34 - 34:1	1:11 - 12:1	1:4 - 3:1
1	ヘキサジノン	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	ヒダントシン	1:1100 - 16:1	1:385 - 8:1	1:144 - 4:1
1	イマザモックス	1:13 - 84:1	1:4 - 28:1	1:1 - 6:1
1	イマザピック	1:20 - 56:1	1:6 - 19:1	1:2 - 4:1
1	イマザビル	1:85 - 14:1	1:28 - 5:1	1:10 - 1:2
1	イマザキン	1:34 - 34:1	1:11 - 12:1	1:4 - 3:1
1	イマゼタベンズ-メチル	1:171 - 7:1	1:57 - 3:1	1:21 - 1:3
1	イマゼタピル	1:24 - 48:1	1:8 - 16:1	1:3 - 3:1
1	イマゾスルフロン	1:27 - 42:1	1:9 - 14:1	1:3 - 3:1
1	インダノファン	1:342 - 4:1	1:114 - 2:1	1:42 - 1:5
1	インダジフラム	1:25 - 45:1	1:8 - 15:1	1:3 - 3:1
1	ヨードスルフロン-メチル	1:3 - 336:1	1:1 - 112:1	2:1 - 21:1
1	イオキシニル	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	イプフェンカルバゾン	1:85 - 14:1	1:28 - 5:1	1:10 - 1:2
1	イソプロツロン	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	イソキサベン	1:288 - 4:1	1:96 - 2:1	1:36 - 1:4
1	イソキサフルトール	1:60 - 20:1	1:20 - 7:1	1:7 - 2:1
1	ラクトフェン	1:42 - 27:1	1:14 - 9:1	1:5 - 2:1
1	レナシル	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	リニュロン	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	MCPA	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	MCPB	1:288 - 4:1	1:96 - 2:1	1:36 - 1:4
1	メコプロップ	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	メフェナセット	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	メフルイジド	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3

【0269】

【表 2 8】

構成成分(a) (化合物番号)	構成成分(b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
1	メソスルフロン-メチル	1:5 - 224:1	1:1 - 75:1	1:1 - 14:1
1	メソトリオン	1:42 - 27:1	1:14 - 9:1	1:5 - 2:1
1	メタミホップ	1:42 - 27:1	1:14 - 9:1	1:5 - 2:1
1	メタザクロール	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	メタゾスルフロン	1:25 - 45:1	1:8 - 15:1	1:3 - 3:1
1	メタベンズチアズロン	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	メトラクロール	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	メトラム	1:8 - 135:1	1:2 - 45:1	1:1 - 9:1
1	メトリブジン	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	メトスルフロン-メチル	1:2 - 560:1	1:1 - 187:1	3:1 - 35:1
1	モリネート	1:1028 - 2:1	1:342 - 1:3	1:128 - 1:15
1	ナプロパミド	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	ナプロパミド-M	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	ナプタラム	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	ニコスルフロン	1:12 - 96:1	1:4 - 32:1	1:1 - 6:1
1	ノルフルラゾン	1:1152 - 1:1	1:384 - 1:3	1:144 - 1:16
1	オルベンカルブ	1:1371 - 1:2	1:457 - 1:4	1:171 - 1:20
1	オルトスルファムロン	1:20 - 56:1	1:6 - 19:1	1:2 - 4:1
1	オリザリン	1:514 - 3:1	1:171 - 1:2	1:64 - 1:8
1	オキサジアルギル	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	オキサジアゾン	1:548 - 3:1	1:182 - 1:2	1:68 - 1:8
1	オキサスルフロン	1:27 - 42:1	1:9 - 14:1	1:3 - 3:1
1	オキサジクロメホン	1:42 - 27:1	1:14 - 9:1	1:5 - 2:1
1	オキシフルオルフェン	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	パラコート	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	ベンジメタリン	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	ペノキスラム	1:10 - 112:1	1:3 - 38:1	1:1 - 7:1
1	ペントキサミド	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	ペントキサゾン	1:102 - 12:1	1:34 - 4:1	1:12 - 1:2
1	フェンメジファム	1:102 - 12:1	1:34 - 4:1	1:12 - 1:2
1	ピクロラム	1:96 - 12:1	1:32 - 4:1	1:12 - 1:2
1	ピコリナフェン	1:34 - 34:1	1:11 - 12:1	1:4 - 3:1
1	ピノキサデン	1:25 - 45:1	1:8 - 15:1	1:3 - 3:1
1	プレチラクロール	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	プリミスルフロン-メチル	1:8 - 135:1	1:2 - 45:1	1:1 - 9:1

【0270】

【表 2 9】

<u>構成成分(a) (化合物番号)</u>	<u>構成成分(b)</u>	<u>典型的な 重量比</u>	<u>より典型的な 重量比</u>	<u>最も典型的な 重量比</u>
1	プロジアミン	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	プロホキシジム	1:42 - 27:1	1:14 - 9:1	1:5 - 2:1
1	プロメトリン	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	プロバクロール	1:1152 - 1:1	1:384 - 1:3	1:144 - 1:16
1	プロパニル	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	プロバキザホップ	1:48 - 24:1	1:16 - 8:1	1:6 - 2:1
1	プロポキシカルバゾン	1:17 - 68:1	1:5 - 23:1	1:2 - 5:1
1	プロピリスルフロン	1:17 - 68:1	1:5 - 23:1	1:2 - 5:1
1	プロビザミド	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	プロスルホカルブ	1:1200 - 1:2	1:400 - 1:4	1:150 - 1:17
1	プロスルフロン	1:6 - 168:1	1:2 - 56:1	1:1 - 11:1
1	ピラクロニル	1:42 - 27:1	1:14 - 9:1	1:5 - 2:1
1	ピラフルフェン-エチル	1:5 - 224:1	1:1 - 75:1	1:1 - 14:1
1	ピラスルホトール	1:13 - 84:1	1:4 - 28:1	1:1 - 6:1
1	ピラゾリネット	1:857 - 2:1	1:285 - 1:3	1:107 - 1:12
1	ピラゾスルフロン-エチル	1:10 - 112:1	1:3 - 38:1	1:1 - 7:1
1	ピラゾキシフェン	1:5 - 224:1	1:1 - 75:1	1:1 - 14:1
1	ピリベンゾキシム	1:10 - 112:1	1:3 - 38:1	1:1 - 7:1
1	ピリブチカルブ	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	ピリデート	1:288 - 4:1	1:96 - 2:1	1:36 - 1:4
1	ピリフタリド	1:10 - 112:1	1:3 - 38:1	1:1 - 7:1
1	ピリミノバッカ-メチル	1:20 - 56:1	1:6 - 19:1	1:2 - 4:1
1	ピリミスルファン	1:17 - 68:1	1:5 - 23:1	1:2 - 5:1
1	ピリチオバッカ	1:24 - 48:1	1:8 - 16:1	1:3 - 3:1
1	ピロキサスルホン	1:85 - 14:1	1:28 - 5:1	1:10 - 1:2
1	ピロキシラム	1:5 - 224:1	1:1 - 75:1	1:1 - 14:1
1	キンクロラック	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	キザロホップ-エチル	1:42 - 27:1	1:14 - 9:1	1:5 - 2:1
1	リムスルフロン	1:13 - 84:1	1:4 - 28:1	1:1 - 6:1
1	サフルフェナシル	1:25 - 45:1	1:8 - 15:1	1:3 - 3:1
1	セトキシジム	1:96 - 12:1	1:32 - 4:1	1:12 - 1:2
1	シマジン	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	スルコトリオン	1:120 - 10:1	1:40 - 4:1	1:15 - 1:2
1	スルフェントラゾン	1:147 - 8:1	1:49 - 3:1	1:18 - 1:3
1	スルホメツロン-メチル	1:34 - 34:1	1:11 - 12:1	1:4 - 3:1

【0271】

【表 3 0】

<u>構成成分(a)</u> (化合物番号)	<u>構成成分(b)</u>	<u>典型的な 重量比</u>	<u>より典型的な 重量比</u>	<u>最も典型的な 重量比</u>
1	スルホスルフロン	1:8 - 135:1	1:2 - 45:1	1:1 - 9:1
1	テブチウロン	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	テフリルトリオン	1:42 - 27:1	1:14 - 9:1	1:5 - 2:1
1	テンボトリオン	1:31 - 37:1	1:10 - 13:1	1:3 - 3:1
1	テプラロキシジム	1:25 - 45:1	1:8 - 15:1	1:3 - 3:1
1	ターバシル	1:288 - 4:1	1:96 - 2:1	1:36 - 1:4
1	テルブチラジン	1:857 - 2:1	1:285 - 1:3	1:107 - 1:12
1	テルブトリン	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	テニルクロール	1:85 - 14:1	1:28 - 5:1	1:10 - 1:2
1	チアゾビル	1:384 - 3:1	1:128 - 1:1	1:48 - 1:6
1	チエンカルバゾン	1:3 - 336:1	1:1 - 112:1	2:1 - 21:1
1	チフェンスルフロン-メチル	1:5 - 224:1	1:1 - 75:1	1:1 - 14:1
1	チアフェナシル	1:17 - 68:1	1:5 - 23:1	1:2 - 5:1
1	チオベンカルブ	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	トルビラレート	1:31 - 37:1	1:10 - 13:1	1:3 - 3:1
1	トプラムゾン	1:6 - 168:1	1:2 - 56:1	1:1 - 11:1
1	トラルコキシジム	1:68 - 17:1	1:22 - 6:1	1:8 - 2:1
1	トリアファモン	1:2 - 420:1	1:1 - 140:1	2:1 - 27:1
1	トリアレート	1:768 - 2:1	1:256 - 1:2	1:96 - 1:11
1	トリアスルフロン	1:5 - 224:1	1:1 - 75:1	1:1 - 14:1
1	トリアジフラム	1:171 - 7:1	1:57 - 3:1	1:21 - 1:3
1	トリベヌロン-メチル	1:3 - 336:1	1:1 - 112:1	2:1 - 21:1
1	トリクロピル	1:192 - 6:1	1:64 - 2:1	1:24 - 1:3
1	トリフロキシスルフロン	1:2 - 420:1	1:1 - 140:1	2:1 - 27:1
1	トリフルジモキサジン	1:25 - 45:1	1:8 - 15:1	1:3 - 3:1
1	トリフルラリン	1:288 - 4:1	1:96 - 2:1	1:36 - 1:4
1	トリフルスルフロン-メチル	1:17 - 68:1	1:5 - 23:1	1:2 - 5:1
1	トリトスルフロン	1:13 - 84:1	1:4 - 28:1	1:1 - 6:1

【0272】

表 A 2 は、「構成成分 (a)」欄の見出しの下の記入事項が、以下に示した各構成成分 (a) 欄の記入事項で置き換えられていることを除いて、上記の表 A 1 と同様に構成されている。構成成分 (a) 欄中の化合物 2 は、索引表 A に特定されている。したがって、例えば、表 A 2 において、「構成成分 (a)」欄の見出しの下の記入事項はすべて「化合物 2」(すなわち、索引表 A において特定された化合物 2)を指し、表 A 2 における欄の見出しの下の第 1 行は、化合物 2 と 2, 4 - Dとの混合物を特に開示している。表 A 3 ~ A 35 も同様に構成されている。

【0273】

10

20

30

40

【表 3 1】

<u>表番号</u>	<u>構成成分(a)欄記入事項</u>	<u>表番号</u>	<u>構成成分(a)欄記入事項</u>
A2	化合物 2	A19	化合物 19
A3	化合物 3	A20	化合物 20
A4	化合物 4	A21	化合物 21
A5	化合物 5	A22	化合物 22
A6	化合物 6	A23	化合物 23
A7	化合物 7	A24	化合物 24
A8	化合物 8	A25	化合物 25
A9	化合物 9	A26	化合物 26
A10	化合物 10	A27	化合物 27
A11	化合物 11	A28	化合物 28
A12	化合物 12	A29	化合物 29
A13	化合物 13	A30	化合物 30
A14	化合物 14	A31	化合物 31
A15	化合物 15	A32	化合物 32
A16	化合物 16	A33	化合物 33
A17	化合物 17	A34	化合物 34
A18	化合物 18	A35	化合物 35

【0274】

望ましくない植生のより良好な防除（例えば、相乗作用などによる使用量の低減、より広範囲の雑草の防除または作物の安全性の強化）のため、または抵抗性雑草の発生を防止するために好ましいのは、本発明の化合物とクロリムロン - エチル、ニコスルフロン、メソトリオン、チフェンスルフロン - メチル、フルピルスルフロン - メチル、トリベニュロン、ピロキサスルホン、ピノキサデン、テンボトリオン、ピロキシスマム、メトラクロールおよびS - メトラクロールからなる群から選択される除草剤との混合物である。

【0275】

以下の試験は、特定の雑草に対する本発明の化合物の防除効力を証明する。しかし、これらの化合物によって得られる雑草防除はこれらの種に特に限定されるものではない。化合物の説明については索引表Aを参照されたい。索引表の中では、以下の略語を使用する：P hは、フェニルである。略語「C m p d . N o .」は、「化合物番号」を意味する。略語「E x .」は「実施例」を表し、その化合物がどの実施例において調製されるかを示す数字が後に続く。質量スペクトルは、大気圧化学イオン化法（A P +）を使用することにより観察された分子へのH +（分子量1）の添加によって形成される最高同位体存在度親イオンの分子量（M + 1）として± 0 . 5 D aの以内の推定精度を伴って報告されている。変量Aについて下記に示すように、左側に突き出ている結合はQ¹部分に接続されており、右側に突き出している結合は、式1の残りに接続されている。

【0276】

索引表 A

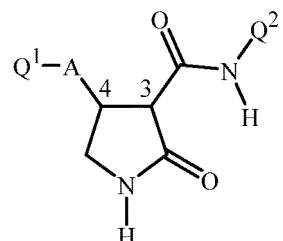
10

20

30

40

【化37】



【0277】

10

【表32】

化合物番号	Q ¹	Q ²	A	融点(℃)	M-1	M+1	
1	Ph(3-Cl)	Ph(2,3-ジ-F)	-CH ₂ -	132-134			
2	Ph(3-Cl)	Ph(2-F)	-CH ₂ -	122-125			
3	Ph	Ph(2-F)	-CH ₂ -	132-135			
4	Ph	Ph(2,3-ジ-F)	-CH ₂ -	182-185			
5	Ph(2-CF ₃)	Ph(2-CF ₃)	-CH ₂ -		429	431	
6	Ph(4-CF ₃)	Ph(2-CF ₃)	-CH ₂ -	136-139			
7	Ph(4-CF ₃)	Ph(2,3-ジ-F)	-CH ₂ -	198-201			20
8	Ph(2,3-ジ-F)	Ph(2,3-ジ-F)	-CH ₂ -	149-153			
9	Ph(2-CF ₃)	Ph(2,3-ジ-F)	-CH ₂ -	173-177			
10	Ph(2,3-ジ-F)	Ph(2-CF ₃)	-CH ₂ -	131-135			
11	Ph(3-CF ₃)	Ph(2,3-ジ-F)	-CH ₂ -	179-182			
12	Ph(3,4-ジ-F)	Ph(2,3-ジ-F)	-CH ₂ -	162-168			
13 (実施例 1)	Ph(4-F)	Ph(2,3-ジ-F)	-CH ₂ -	173-176			
14	Ph(4-F)	Ph(2-F)	-CH ₂ -	135-138			
15	Ph(4-F)	Ph(2-F)	-NHC(=O)(CH ₂) ₂ -		386	388	
16	Ph(4-F)	Ph(2,3-ジ-F)	-C≡C-	185-188			
17	Ph(4-F)	Ph(2,3,4-トJ-F)	-C≡C-	186-189			30
18	Ph(3-CF ₃)	Ph(2,3-ジ-F)	-NHC(=O)-		426	428	
19	Ph(4-F)	Ph(2-F)	-C≡C-	184-187			
20	Ph	Ph(2-F)	-(CH ₂) ₂ -	141-144			
21	Ph(3-CH ₃)	Ph(2-F)	-C≡C-	123-127			
22	Ph(3-CH ₃)	Ph(2,3-ジ-F)	-C≡C-	155-157			
23	Ph(3-CH ₃)	Ph(2,3,4-トJ-F)	-C≡C-	172-176			
24	Ph(3-F)	Ph(2-F)	-HC=CH- *	168-172			
25 (実施例 4)	Ph(3-Cl)	Ph(2,3-ジ-F)	-C≡C-	154-156			
26	Ph(3-Cl)	Ph(2,3,4-トJ-F)	-C≡C-	178-182			
27	Ph(4-F)	Ph(2-F)	-HC=CH- *	160-163			40
28	Ph(2-F)	Ph(2,3-ジ-F)	-HC=CH- *	204-206			
29	Ph(3-Cl)	Ph(2-F)	-C≡C-	120-124			
30	Ph(3-F)	Ph(2,3-ジ-F)	-HC=CH- *	181-185			
31	Ph(4-F)	Ph(2,3-ジ-F)	-HC=CH- *	194-197			
32	Ph	Ph(2-F)	-HC=CH- *	160-164			
33 (実施例 2)	Ph	Ph(2,3-ジ-F)	-HC=CH- *	200-204			
34	Ph(2-F)	Ph(2-F)	-HC=CH- *	161-164			
35 (実施例 3)	Ph	Ph(2,3-ジ-F)	-(CH ₂) ₂ -	142-145			

* E 異性体として調製された

【0278】

50

本発明の生物学的実施例

試験 A

イヌビエ(エキノクロア・クルスガリ(*Echinochloa crus-galli*)、メシヒバ(オオメヒシバ、ジギタリア・サングイナリス(*Digitaria sanguinalis*))、ホウキギ(ニワクサ(*Kochia scoparia*))、ブタクサ(ブタクサ(*common ragweed*))、アサガオ(サツマイモ種(*Ipomoea spp.*))、ベルベットリーフ(イチビ(*Abutilon theophrasti*))、イタリアン・ライグラス(イタリアン・ライグラス(*Italian ryegrass*))、(ロリウム・マルチフロラム(*Lolium multiflorum*))、アキノエノコログサ(アキノエノコログサ(*Setaria faberii*))、コムギ(トリチクム・アエスチブム(*Triticum aestivum*))、コーン(トウモロコシ(*Zea mays*))およびアカザ(アオゲイトウ(*Amaranthus retroflexus*))から選択される植物種の種子をローム土壤と砂とのブレンドに植え、界面活性剤を含む非植物毒性溶媒混合物中で処方した試験薬剤を使用して直接土壤噴霧で発芽前処理した。

【0279】

同時に、これらの作物および雑草種ならびにさらにスズメノテッポウ(アロペクルス・ミオスロイデス(*Alopeurus myosuroides*))、およびヤエムグラ(キャッチウィード・ベッドストロー(*catchweed bedstraw*))、ガリウム・アパリン(*Galium aparine*))から選択される植物をローム土壤と砂との同一のブレンドを含むポットに植え、同様に処方した試験薬剤の発芽後適用で処理した。発芽後処理については、植物は、高さが2~10cmであり、1~2葉期であった。処理した植物および未処理のコントロールを温室中におよそ10日間維持し、その後、すべての処理した植物を未処理のコントロールと比較し、被害について視覚的に評価した。表Aに要約した植物の応答評価は、0~100スケールに基づいており、0は効果なしであり、100は完全な防除である。ダッシュ(-)応答は、試験結果が得られなかつたことを意味する。

【0280】

【表33】

1000g(有効成分)/ha	化合物					
	1	2	3	4	13	14
発芽後						
イヌビエ	80	30	0	0	80	0
コーン	0	0	0	0	0	0
メヒシバ	80	80	0	20	80	20
エノコログサ	80	60	0	0	60	0
アサガオ	0	0	0	0	0	0
アカザ	0	0	0	0	0	0
ベルベットリーフ	10	0	0	0	0	0

【0281】

【表34】

コムギ	0	0	0	0	0	0														
表A 化合物																				
500g(有効成分)/ha	5	6	7	8	9	10	11	12	15	16	17	18	19	20						
発芽後																				
イヌビエ	0	0	60	0	60	0	0	0	0	60	90	30	40	0						
スズメノテッポウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	30	0	0						
コーン	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0					10	
エノコログサ	0	0	20	0	0	0	0	0	0	40	50	50	20	0						
ヤエムグラ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	50	0	0						
ホウキギ	0	0	0	0	30	0	0	0	0	0	0	0	0	0						
アカザ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	30	0	0						
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0						
イタリアンライグラス	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0						
コムギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0						
表A 化合物																				
500g(有効成分)/ha	21	22	23	24	25	26	27	28	29	30	31	32	33	34	35				20	
発芽後																				
イヌビエ	50	70	50	70	70	60	60	70	60	80	70	90	90	60	30					
スズメノテッポウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0					
コーン	0	20	0	0	0	0	0	0	0	20	20	20	0	0	0					
エノコログサ	20	50	50	80	80	40	70	50	60	80	60	80	70	80	30					
ヤエムグラ	0	20	20	0	60	0	0	20	0	20	30	0	0	0	0					
ホウキギ	0	0	20	-	0	0	-	0	0	0	30	0	0	0	0					
アカザ	0	0	0	0	20	0	20	0	0	0	0	0	0	0	0				30	
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20	10	10	0					
イタリアンライグラス	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20	0	0	0					
コムギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20	0	0	0	20	0					
表A 化合物																				
125g(有効成分)/ha	5	6	7	8	9	10	11	12	15	16	17	18	19	20						
発芽後																				
イヌビエ	0	0	0	0	10	0	0	0	0	40	20	20	0	0						
スズメノテッポウ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20	0	0					40	
コーン	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0						
エノコログサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20	0	20	0	0					
ヤエムグラ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0					
ホウキギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0					
アカザ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0					

【0282】

【表 3-5】

【 0 2 8 3 】

【表36】

500g(有効成分)/ha	化合物														
	21	22	23	24	25	26	27	28	29	30	31	32	33	34	35
発芽前															
イヌビエ	80	80	80	70	90	70	50	90	70	90	70	60	90	80	30
エノコログサ	0	70	80	90	90	70	60	90	60	90	70	80	90	80	60
ホウキギ	0	20	0	20	60	0	40	0	0	80	20	0	20	0	50
アカザ	0	0	0	0	50	40	0	0	0	0	0	0	0	100	0
ブタクサ	0	0	0	30	0	0	30	0	0	0	0	0	0	0	0
イタリアンライグラス	20	0	0	0	0	0	20	0	0	0	0	0	0	0	0
表A															10
125g(有効成分)/ha	化合物														20
	5	6	7	8	9	10	11	12	15	16	17	18	19	20	
発芽前															
イヌビエ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20	20	20	0	0	
エノコログサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	60	30	50	0	0	
ホウキギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
アカザ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	20
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
イタリアンライグラス	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
表A															
125g(有効成分)/ha	化合物														30
	21	22	23	24	25	26	27	28	29	30	31	32	33	34	35
発芽前															
イヌビエ	20	60	60	30	60	0	0	50	30	50	0	20	50	20	0
エノコログサ	0	50	40	60	40	0	0	50	0	60	20	0	50	20	0
ホウキギ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	70	0	0	0	0	
アカザ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	80	0
ブタクサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
イタリアンライグラス	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	

【0284】

試験B

イネ(オリザ・サティバ(*Oryza sativa*))、カヤツリグサ(スモール・フラワー・アンブレラ・セッジ(*small-flower umbrella sedges*))、シペルス・ディフォルミス(*Cyperus diff formis*))、アメリカコナギ(ヘテランテラ・リモサ(*Heteranthera limosa*))およびイヌビエ(エキノクロア・クルスガリ(*Echinochloa crus-galli*))から選択される、冠水させた水田試験における植物種を試験のために2葉期まで成長させた。処理時に、試験ポットを土壤表面から3cm上まで冠水させ、試験化合物を田面水に直接適用することにより処理し、その後は、試験期間中その水深で維持した。処理した植物およびコントロールを温室中で13~15日間維持し、その後に、すべての種をコントロールと比較して視覚的に評価した。表Bに要約した植物の応答評価は、0~100のスケールに基づいており、0は効果なしであり、100は完全な防除である。ダッシュ(-)応答は、試験結果が得られなかつことを意味する。

【0285】

【表37】

表B	化合物		表B	化合物									
1000g(有効成分)/ha	1	2	250g(有効成分)/ha	13									
冠水			冠水										
イヌビエ	0	0	イヌビエ	0									
アメリカコナギ	50	0	アメリカコナギ	0									
イネ	0	0	イネ	0									
カヤツリグサ	0	0	カヤツリグサ	0	10								
表B	化合物												
500g(有効成分)/ha	5	6	7	8	9	10	11	12	15				
冠水													
イヌビエ	0	0	25	0	0	0	0	0	0				
アメリカコナギ	0	0	75	0	40	0	0	0	70				
イネ	0	0	0	0	0	0	0	0	0				
カヤツリグサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0				
表B	化合物												
250g(有効成分)/ha	16	17	18	19	20	21	22	23	24	25	26	27	28
冠水													
イヌビエ	0	0	30	0	0	0	0	0	70	0	0	0	90
アメリカコナギ	70	70	40	0	50	40	70	0	90	85	75	80	90
イネ	0	0	15	0	0	0	0	0	0	20	0	0	10
カヤツリグサ	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	50
表B	化合物												
250g(有効成分)/ha	29	30	31	32	33	34	35						
冠水													
イヌビエ	0	70	40	0	40	0	0						
アメリカコナギ	75	95	80	70	95	80	70						
イネ	0	15	15	0	0	15	0						
カヤツリグサ	0	0	50	0	0	60	0						

フロントページの続き

(72)発明者 アンドリュー・ダンカン・サッターフィールド
アメリカ合衆国デラウェア州 19707. ホッケシン. ラファエルロード 12

審査官 山本 昌広

(56)参考文献 特表2006-513995(JP,A)
特開平5-43543(JP,A)
特表平4-503947(JP,A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07D 207/00 - 207/50
A01N 1/00 - 65/48
A01P 1/00 - 23/00
Caplus / REGISTRY (STN)