

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】令和 1 年 12 月 5 日 (2019.12.5)

【公表番号】特表 2018-533577 (P2018-533577A)

【公表日】平成 30 年 11 月 15 日 (2018.11.15)

【年通号数】公開・登録公報 2018-044

【出願番号】特願 2018-522012 (P2018-522012)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 405/04 (2006.01)

C 0 7 D 409/04 (2006.01)

C 0 7 D 417/04 (2006.01)

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

A 0 1 P 13/00 (2006.01)

A 0 1 N 43/90 (2006.01)

A 0 1 N 43/58 (2006.01)

A 0 1 N 43/80 (2006.01)

A 0 1 N 43/78 (2006.01)

A 0 1 N 47/06 (2006.01)

A 0 1 N 43/647 (2006.01)

A 0 1 N 43/56 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/04

C 0 7 D 405/04 C S P

C 0 7 D 409/04

C 0 7 D 417/04

C 0 7 D 495/04 1 0 5 A

C 0 7 D 403/04

A 0 1 P 13/00

A 0 1 N 43/90 1 0 2

A 0 1 N 43/58 B

A 0 1 N 43/80 1 0 2

A 0 1 N 43/78 1 0 1

A 0 1 N 47/06 D

A 0 1 N 43/647

A 0 1 N 43/56 G

【手続補正書】

【提出日】令和 1 年 10 月 25 日 (2019.10.25)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 0 4

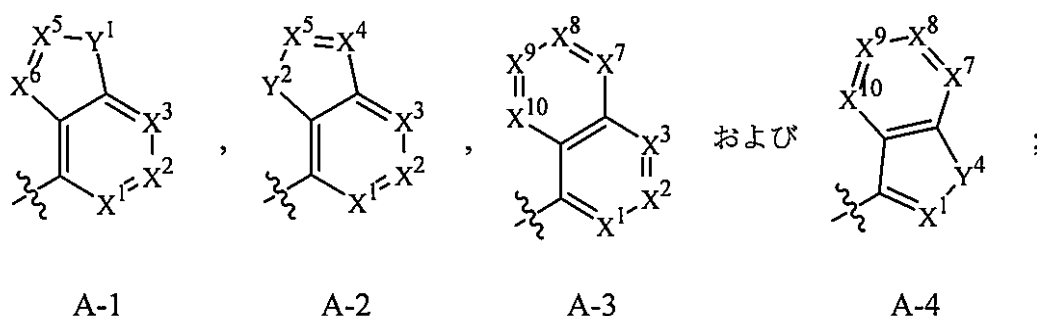
【補正方法】変更

【補正の内容】

【 0 0 0 4 】

A は、

## 【化 2】



から選択され；

G は、G<sup>1</sup> または W<sup>1</sup> G<sup>1</sup> であり；

W<sup>1</sup> は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルカンジイルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルケンジイルであり；

G<sup>1</sup> は、H、-C(=O)R<sup>7</sup>、-C(=S)R<sup>7</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>、-C(=O)SR<sup>8</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>7</sup>、-CONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup> もしくは P(=O)R<sup>11</sup>；または C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルコキシアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキルもしくは C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキル；または 5 もしくは 6 員複素環式環であり；

R<sup>2</sup> は、H、ハロゲン、-CN、-CHO、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルカルボニルアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシカルボニルアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキルカルボニルオキシ、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキルシクロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルアミノ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ジアルキルアミノ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> シアノアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ニトロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルコキシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルキルチオもしくは C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコキシカルボニル；またはハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルもしくは C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルによって場合により置換されているフェニルであり；

各 X<sup>1</sup> は、独立して N または CR<sup>3</sup> であり；

各 X<sup>2</sup> は、独立して N または CR<sup>3</sup> であり；

各 X<sup>3</sup> は、独立して N または CR<sup>3</sup> であり；

各 X<sup>4</sup>、X<sup>5</sup> および X<sup>6</sup> は、独立して N または CR<sup>4</sup> であり；

各 X<sup>7</sup>、X<sup>8</sup>、X<sup>9</sup> および X<sup>10</sup> は、独立して N または CR<sup>5</sup> であり；

Y<sup>1</sup> は、O、S または NR<sup>6</sup> であり；

Y<sup>2</sup> は、O、S または NR<sup>6</sup> であり；

Y<sup>4</sup> は、O、S または NR<sup>6</sup> であり；

各 R<sup>3</sup> は、独立して H、ハロゲン、ニトロ、-CN、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>5</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>5</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルキニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルキルチオまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシカルボニルであり；

各 R<sup>4</sup> は、独立して H、ハロゲン、ニトロ、-CN、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>5</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>5</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアルキニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> ハロアル

コキシ、 $C_1 \sim C_5$  アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_5$  ハロアルキルチオまたは $C_2 \sim C_5$  アルコキシカルボニルであり；

各 $R^5$ は、独立してH、ハロゲン、 $-CN$ 、ニトロ、 $C_1 \sim C_5$  アルキル、 $C_2 \sim C_5$  アルケニル、 $C_2 \sim C_5$  アルキニル、 $C_3 \sim C_5$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_5$  シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_5$  ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$  ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_5$  ハロアルキニル、 $C_2 \sim C_5$  アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_5$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_5$  ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_5$  アルキルチオ、 $C_1 \sim C_5$  ハロアルキルチオまたは $C_2 \sim C_5$  アルコキシカルボニルであり；

$R^6$ は、H、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_2 \sim C_7$  アルケニル、 $C_2 \sim C_7$  アルキニル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_7$  ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキルであり；

$R^7$ は、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_7$  アルケニル、 $C_3 \sim C_7$  アルキニル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_7$  ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキル；またはフェニル、ベンジルもしくは5～6員複素環式環であり、各フェニル、ベンジルもしくは複素環式環は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  アルキルまたは $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルによって場合により置換されており；

$R^8$ は、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_7$  アルケニル、 $C_3 \sim C_7$  アルキニル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_7$  ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキル；またはフェニル、ベンジルもしくは5～6員複素環式環であり、各フェニル、ベンジルもしくは複素環式環は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  アルキルまたは $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルによって場合により置換されており；

$R^9$ は、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_7$  アルケニル、 $C_3 \sim C_7$  アルキニル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_2 \sim C_7$  ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキル、 $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキル；またはフェニル、ベンジルもしくは5～6員複素環式環であり、各フェニル、ベンジルもしくは複素環式環は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  アルキルまたは $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルによって場合により置換されており；

$R^{10}$ は、H、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_2 \sim C_7$  アルケニル、 $C_2 \sim C_7$  アルキニル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_7$  ハロアルキルまたは $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキルであり；

$R^{11}$ は、 $C_1 \sim C_7$  アルキルまたは $C_1 \sim C_7$  アルコキシであり；

ただし、

i) AがA-3であり、 $X^2$ が $CR^3$ である場合、 $X^3$ は $CR^3$ 以外であり；

ii) AがA-3であり、 $X^3$ が $CR^3$ である場合、 $X^2$ は $CR^3$ 以外であり；

iii) AがA-4であり、 $Y^4$ がO、Sまたは $NR^6$ である場合、 $X^7$ 、 $X^8$ 、 $X^9$ および $X^{10}$ のうちの少なくとも1つは $CR^5$ 以外であり；

iv)  $R^1$ が $CH_3$ であり；GがHまたは $C(=O)CH_3$ であり； $R^2$ がClまたはBrである場合；A-3は4-キノリニル(5-Cl)、5-キノリニル、4-イソキノリニル、5-イソキノリニル、6-イソキノリニルおよび8-イソキノリニル以外である)。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0235

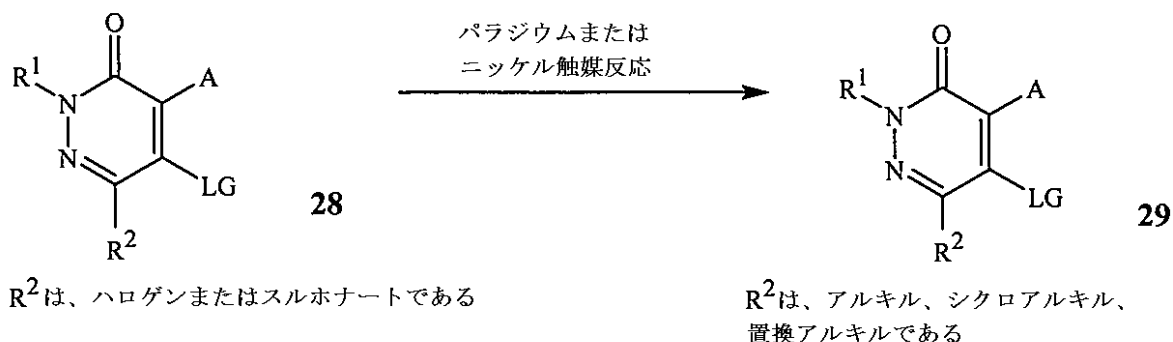
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0235】

【化 3 0】

## スキーム 13



【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0256

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0256】

式 37 の化合物は、スキーム 22 に示すように、式 38 のピリダジノンを式 39 のハロゲン化アルキルでアルキル化することにより製造可能である。反応は、アセトン、2-ブタノン、アセトニトリル、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリジノン、ジメチルスルホキシド、およびジメチルホルムアミドのような種々の溶媒中で実施できる。限定されるものではないが、炭酸セシウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、水酸化カリウム、または水酸化ナトリウムのような酸受容体の存在が好適である。脱離基 Y は、ハロゲンまたはスルホナートとすることができる。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0272

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0272】

工程 C：4, 5-ジクロロ-6-ヨード-2-メチル-3(2H)-ピリダジノンの製造

テトラヒドロフラン 80 mL に溶解させた 4, 5-ジクロロ-2-メチル-3(2H)-ピリダジノン (5.0 g、27.9 mmol) に、トルエン/テトラヒドロフラン中の 2, 2, 6, 6-ビス(テトラメチルピペリジン)亜鉛、塩化マグネシウム、塩化リチウム複合体 0.35 M (即ち、テトラヒドロフラン/トルエン中の  $Zn(TMP)_2 \cdot LiCl \cdot MgCl_2$  54 mL、0.35 M) 18.75 mmol を 3~5 分かけて添加した。混濁した反応混合物を 15 分間攪拌し、次いで、ヨウ素 (8.5 g、33.51 mmol) を添加した。得られた混合物を周囲温度で 15 分間攪拌した。反応混合物を重亜硫酸ナトリウム水溶液で (過剰なヨウ素色を除くために)、次いで水 (200 mL)、続いて 1 N 塩酸水溶液 (100 mL) でクエンチした。混合物を酢酸エチル (300 mL、次いで 200 mL) で抽出した。得られた粗生成物を、石油エーテル中 10% 酢酸エチルで溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製した。固体をジエチルエーテルとペンタンで粉碎し、得られた淡黄色固体を乾燥させた (3 g)。

$^1H$  NMR 3.83 (s, 3H).

【手続補正 5】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

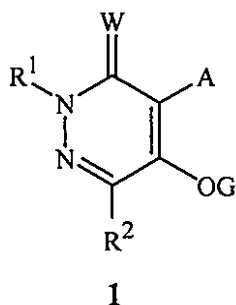
## 【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

式 1 の化合物、その立体異性体、N - オキシド、および塩

## 【化 1】



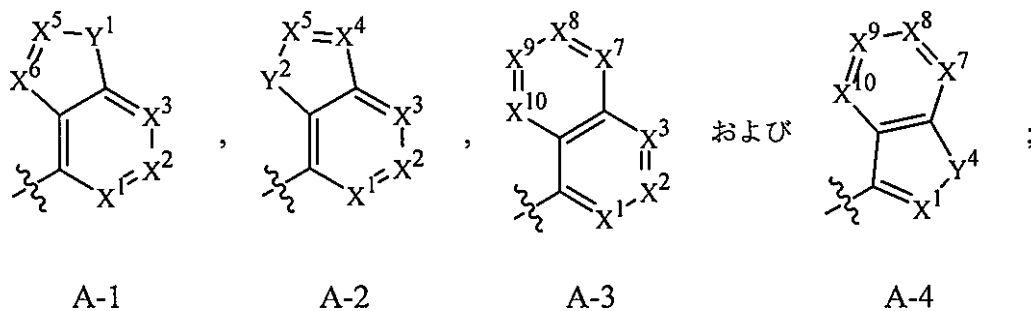
(式中、

R<sup>1</sup> は、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルカルボニルアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコシカルボニルアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキルシクロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub> シアノアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ニトロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルコシアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコシアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキルチオアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルコシ、ベンジルもしくはフェニル；または炭素ならびに 1 個以下の O および 1 個以下の S から選択される環員を含有する 5 もしくは 6 員の飽和もしくは部分飽和の複素環式環であり；

W は、O または S であり；

A は、

## 【化 2】



から選択され；

G は、G<sup>1</sup> または W<sup>1</sup> G<sup>1</sup> であり；

W<sup>1</sup> は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルカンジイルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルケンジイルであり；

G<sup>1</sup> は、H、-C(=O)R<sup>7</sup>、-C(=S)R<sup>7</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>、-C(=O)SR<sup>8</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>7</sup>、-CONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup> もしくは P(=O)R<sup>11</sup>；または C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルコシアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキルもしくは C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキル；または 5 もしくは 6 員複素環式環であり；

R<sup>2</sup> は、H、ハロゲン、-CN、-CHO、C<sub>1</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルカルボニルアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコシカルボニルアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキルカルボニルオキシ、C<sub>4</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキルシクロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> アルキニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>

～C<sub>4</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> アルキルアミノ、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub> ジアルキルアミノ、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub>～C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub> シアノアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> ニトロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub> ハロアルコキシアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub> アルコキシアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> アルキルチオもしくはC<sub>2</sub>～C<sub>3</sub> アルコキシカルボニル；またはハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> アルキルもしくはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> ハロアルキルによって場合により置換されているフェニルであり；

各X<sup>1</sup>は、独立してNまたはCR<sup>3</sup>であり；

各X<sup>2</sup>は、独立してNまたはCR<sup>3</sup>であり；

各X<sup>3</sup>は、独立してNまたはCR<sup>3</sup>であり；

各X<sup>4</sup>、X<sup>5</sup>およびX<sup>6</sup>は、独立してNまたはCR<sup>4</sup>であり；

各X<sup>7</sup>、X<sup>8</sup>、X<sup>9</sup>およびX<sup>10</sup>は、独立してNまたはCR<sup>5</sup>であり；

Y<sup>1</sup>は、O、SまたはNR<sup>6</sup>であり；

Y<sup>2</sup>は、O、SまたはNR<sup>6</sup>であり；

Y<sup>4</sup>は、O、SまたはNR<sup>6</sup>であり；

各R<sup>3</sup>は、独立してH、ハロゲン、ニトロ、-CN、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>5</sub> アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>5</sub> アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>5</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub>～C<sub>5</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>5</sub> ハロアルケニル、C<sub>3</sub>～C<sub>5</sub> ハロアルキニル、C<sub>2</sub>～C<sub>5</sub> アルコキシアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> ハロアルキルチオまたはC<sub>2</sub>～C<sub>5</sub> アルコキシカルボニルであり；

各R<sup>4</sup>は、独立してH、ハロゲン、ニトロ、-CN、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>5</sub> アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>5</sub> アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>5</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub>～C<sub>5</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>5</sub> ハロアルケニル、C<sub>3</sub>～C<sub>5</sub> ハロアルキニル、C<sub>2</sub>～C<sub>5</sub> アルコキシアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> ハロアルキルチオまたはC<sub>2</sub>～C<sub>5</sub> アルコキシカルボニルであり；

各R<sup>5</sup>は、独立してH、ハロゲン、-CN、ニトロ、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>5</sub> アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>5</sub> アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>5</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub>～C<sub>5</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>5</sub> ハロアルケニル、C<sub>3</sub>～C<sub>5</sub> ハロアルキニル、C<sub>2</sub>～C<sub>5</sub> アルコキシアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>5</sub> ハロアルキルチオまたはC<sub>2</sub>～C<sub>5</sub> アルコキシカルボニルであり；

R<sup>6</sup>は、H、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub> アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub> アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub> アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub> シクロアルキル、C<sub>4</sub>～C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub> ハロアルキルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>7</sub> アルコキシアルキルであり；

R<sup>7</sup>は、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub> アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub> アルケニル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub> アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub> アルコキシアルキルもしくはC<sub>4</sub>～C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキル；またはフェニル、ベンジルもしくは5～6員複素環式環であり、各フェニル、ベンジルもしくは複素環式環は、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> アルキルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> ハロアルキルによって場合により置換されており；

R<sup>8</sup>は、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub> アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub> アルケニル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub> アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>7</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>7</sub> アルコキシアルキルもしくはC<sub>4</sub>～C<sub>7</sub> シクロアルキルアルキル；またはフェニル、ベンジルもしくは5～6員複素環式環であり、各フェニル、ベンジルもしくは複素環式環は、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> アルキルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> ハロアルキルによって場合により置換されており；

$R^9$  は、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_7$  アルケニル、 $C_3 \sim C_7$  アルキニル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_2 \sim C_7$  ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキルもしくは  $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキル；またはフェニル、ベンジルもしくは 5 ～ 6 員複素環式環であり、各フェニル、ベンジルもしくは複素環式環は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$  アルキルまたは  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルによって場合により置換されており；

$R^{10}$  は、H、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_2 \sim C_7$  アルケニル、 $C_2 \sim C_7$  アルキニル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキル、 $C_1 \sim C_7$  ハロアルキルまたは  $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキルであり；

$R^{11}$  は、 $C_1 \sim C_7$  アルキルまたは  $C_1 \sim C_7$  アルコキシであり；

ただし、

i) A が A - 3 であり、 $X^2$  が  $CR^3$  である場合、 $X^3$  は  $CR^3$  以外であり；

ii) A が A - 3 であり、 $X^3$  が  $CR^3$  である場合、 $X^2$  は  $CR^3$  以外であり；

iii) A が A - 4 であり、 $Y^4$  が O、S または  $NR^6$  である場合、 $X^7$ 、 $X^8$ 、 $X^9$  および  $X^{10}$  のうちの少なくとも 1 つは  $CR^5$  以外であり；

iv)  $R^1$  が  $CH_3$  であり；G が H または  $C(=O)CH_3$  であり； $R^2$  が Cl または Br である場合；A - 3 は 4 - キノリニル (5 - Cl)、5 - キノリニル、4 - イソキノリニル、5 - イソキノリニル、6 - イソキノリニルおよび 8 - イソキノリニル以外である)。

#### 【請求項 2】

$R^1$  は、H、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_8$  アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 \sim C_8$  アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$  アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$  アルケニル、 $C_3 \sim C_7$  アルキニル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$  シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$  ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_7$  ハロアルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$  ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_7$  アルキルチオアルキル、 $C_1 \sim C_7$  アルコキシ、ベンジルまたはフェニルであり；

W は、O であり；

A は、A - 1、A - 2 または A - 3 であり；

$G^1$  は、H、 $-C(=O)R^7$ 、 $-C(=S)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ 、 $-C(=O)SR^8$ 、 $-CONR^9R^{10}$  もしくは  $P(=O)R^{11}$ ；または  $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_2 \sim C_4$  アルケニル、 $C_2 \sim C_4$  アルキニル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$  ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_4$  アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルもしくは  $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキルであり；

$W^1$  は、 $C_1 \sim C_2$  アルカンジイルまたは  $C_2 \sim C_3$  アルケンジイルであり；

$R^2$  は、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_8$  アルキルカルボニルアルキル、 $C_3 \sim C_8$  アルコキシカルボニルアルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_7$  アルキルカルボニルオキシ、 $C_4 \sim C_7$  アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$  アルケニル、 $C_3 \sim C_7$  アルキニル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_8$  ジアルキルアミノ、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$  シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$  ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_7$  ハロアルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$  ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$  ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$  アルコキシまたは  $C_1 \sim C_5$  アルキルチオであり；

各  $X^1$  は、独立して  $CR^3$  であり；

各  $R^3$  は、独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$  アルキル、 $C_3 \sim C_4$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキルまたは  $C_1 \sim C_3$  アルコキシであり；

各  $R^4$  は、独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$  アルキル、 $C_3 \sim C_4$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキルまたは  $C_1 \sim C_3$  アルコキシであり；

各  $R^5$  は、独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$  アルキル、 $C_3 \sim C_4$  シクロアルキル、

$C_1 \sim C_3$  ハロアルキルまたは  $C_1 \sim C_3$  アルコキシであり；

$R^6$  は、H または  $C_1 \sim C_3$  アルキルであり；

$R^7$  は、H、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキルまたは  $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキルであり；

$R^8$  は、H、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキルまたは  $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキルであり；

$R^9$  は、H、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$  ハロアルキルまたは  $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキルであり；

$R^{10}$  は、H、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキルまたは  $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキルであり；

$R^{11}$  は、 $C_1 \sim C_3$  アルキルまたは  $C_1 \sim C_3$  アルコキシである、  
請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

$R^1$  は、H、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_8$  アルコキシカルボニルアルキル、 $C_4 \sim C_7$  アルキルシクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$  シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$  ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_7$  ハロアルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_7$  アルキルチオアルキル、 $C_1 \sim C_7$  アルコキシまたはベンジルであり；

A は、A - 1 または A - 2 であり；

$G^1$  は、H、 $-C(=O)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ 、 $-CONR^9R^{10}$  もしくは  $P(=O)R^{11}$ ；または  $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_2 \sim C_4$  アルケニル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$  ハロアルケニル、 $C_1 \sim C_4$  アルコキシアルキル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルもしくは  $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキルであり；

$W^1$  は、 $-CH_2-$  または  $-CH=CH-$  であり；

$R^2$  は、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_7$  アルキルカルボニルオキシ、 $C_4 \sim C_7$  アルキルシクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$  アルキルアミノ、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_4 \sim C_7$  シクロアルキルアルキル、 $C_2 \sim C_3$  シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$  ニトロアルキル、 $C_2 \sim C_7$  ハロアルコキシアルキル、 $C_1 \sim C_7$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキルまたは  $C_1 \sim C_7$  アルコキシであり；

各  $X^2$  は、独立して  $CR^3$  であり；

各  $X^5$  は、独立して  $CR^4$  であり；

$Y^1$  は、O または S であり；

$Y^2$  は、O または S であり；

各  $R^3$  は、独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$  アルキル、シクロプロピルまたは  $C_1 \sim C_2$  ハロアルキルであり；

各  $R^4$  は、独立して H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$  アルキル、シクロプロピルまたは  $C_1 \sim C_2$  ハロアルキルであり；

$R^7$  は、H、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキルまたは  $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキルであり；

$R^8$  は、H、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキルまたは  $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキルであり；

$R^9$  は、H、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキルまたは  $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキルであり；

$R^{10}$  は、H、 $C_1 \sim C_7$  アルキル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキルまたは  $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキルであり；

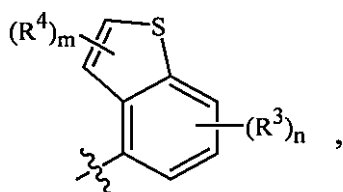
$R^{11}$  は、 $CH_3$  または  $OCH_3$  である、  
請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

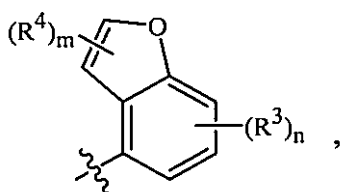
$R^1$  は、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_3 \sim C_4$  シクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$  シアノアルキル、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキルまたは  $C_2 \sim C_4$  アルコシアルキルであり；

A は、

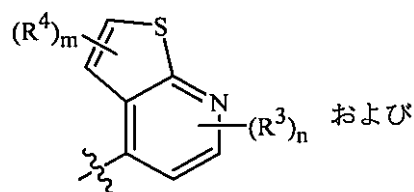
【化 3】



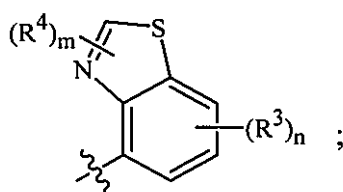
A-1-A



A-1-B



A-1-C



A-1-D

から選択され；

$G^1$  は、 $H$ 、 $-C(=O)R^7$ 、 $-CO_2R^8$  もしくは  $P(=O)R^{11}$ ；または  $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルコシアルキルもしくは  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルであり；

$W^1$  は、 $-CH_2-$  であり；

$R^2$  は、 $H$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_3 \sim C_5$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$  アルコシアルキルまたは  $C_1 \sim C_3$  アルコシであり；

各  $R^3$  は、独立して  $H$ 、ハロゲン、メチル、エチルまたは  $CF_3$  であり；

各  $R^4$  は、独立して  $H$ 、ハロゲン、メチル、エチルまたは  $CF_3$  であり；

$R^7$  は、 $C_1 \sim C_7$  アルキルまたは  $C_2 \sim C_7$  アルコシアルキルであり；

$R^8$  は、 $C_1 \sim C_7$  アルキルまたは  $C_2 \sim C_7$  アルコシアルキルであり；

$R^{11}$  は、 $OCH_3$  である、

請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

$R^1$  は、メチル、エチル、 $n$ -プロピルまたは 2-メトキシエチルであり；

A は、A-1-A および A-1-B から選択され；

G は、 $G^1$  であり；

$G^1$  は、 $H$ 、 $-C(=O)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ ；または  $C_1 \sim C_4$  アルコシアルキルもしくは  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルであり；

$R^2$  は、 $H$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $-CN$ 、メチルまたはメトキシであり；

各  $R^3$  は、独立して  $H$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$  またはメチルであり；

各  $R^4$  は、独立して  $H$ 、メチルまたはエチルであり；

$R^7$  は、 $C_1 \sim C_3$  アルキルまたは  $C_2 \sim C_4$  アルコシアルキルであり；

$R^8$  は、 $C_1 \sim C_3$  アルキルまたは  $C_2 \sim C_4$  アルコシアルキルである、

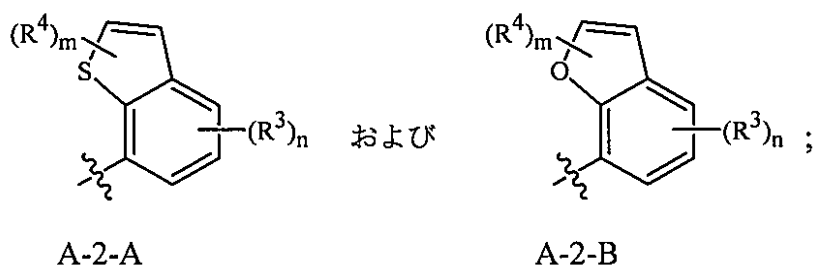
請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

$R^1$  は、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_3 \sim C_4$  シクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$  シアノアルキル、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキルまたは  $C_2 \sim C_4$  アルコシアルキルであり；

A は、

## 【化 4】



から選択され；

$G^1$  は、 $H$ 、 $-C(=O)R^7$ 、 $-CO_2R^8$  もしくは  $P(=O)R^{11}$ ；または  $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルコキシアルキルもしくは  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルであり；

$W^1$  は、 $-CH_2-$  であり；

$R^2$  は、 $H$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_3 \sim C_5$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$  ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$  アルコキシアルキルまたは  $C_1 \sim C_3$  アルコキシであり；

各  $R^3$  は、独立して  $H$ 、ハロゲン、メチル、エチルまたは  $CF_3$  であり；

各  $R^4$  は、独立して  $H$ 、ハロゲン、メチル、エチルまたは  $CF_3$  であり；

$R^7$  は、 $C_1 \sim C_7$  アルキルまたは  $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキルであり；

$R^8$  は、 $C_1 \sim C_7$  アルキルまたは  $C_2 \sim C_7$  アルコキシアルキルであり；

$R^{11}$  は、 $OCH_3$  である、

請求項 3 に記載の化合物。

## 【請求項 7】

$R^1$  は、メチル、エチル、 $n$ -プロピルまたは 2-メトキシエチルであり；

$A$  は、A-2-A であり；

$G$  は、 $G^1$  であり；

$G^1$  は、 $H$ 、 $-C(=O)R^7$ 、 $-CO_2R^8$ ；または  $C_1 \sim C_4$  アルコキシアルキルもしくは  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルであり；

$R^2$  は、 $H$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $-CN$ 、メチルまたはメトキシであり；

各  $R^3$  は、独立して  $H$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$  またはメチルであり；

各  $R^4$  は、独立して  $H$ 、メチルまたはエチルであり；

$R^7$  は、 $C_1 \sim C_3$  アルキルまたは  $C_2 \sim C_4$  アルコキシアルキルであり；

$R^8$  は、 $C_1 \sim C_3$  アルキルまたは  $C_2 \sim C_4$  アルコキシアルキルである、

請求項 6 に記載の化合物。

## 【請求項 8】

4-(2,6-ジメチル-7-ベンゾフラニル)-5-ヒドロキシ-2,6-ジメチル-3(2H)-ピリダジノン；

5-(アセチルオキシ)-4-(2,6-ジメチル-7-ベンゾフラニル)-2,6-ジメチル-3(2H)-ピリダジノン；

5-ヒドロキシ-2,6-ジメチル-4-(3-メチル-1,2-ベンゾイソチアゾール-4-イル)-3(2H)-ピリダジノン；

5-ヒドロキシ-2,6-ジメチル-4-(5-メチルベンゾ[b]チエン-4-イル)-3(2H)-ピリダジノン；および

1,6-ジヒドロ-1,3-ジメチル-5-(5-メチルベンゾ[b]チエン-4-イル)-6-オキソ-4-ピリダジニルエチルカルボナート

からなる群から選択される、請求項 6 に記載の化合物。

## 【請求項 9】

請求項 1 に記載の化合物と、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種の成分とを含む除草用組成物。

【請求項１０】

請求項１に記載の化合物と、他の除草剤および除草剤薬害軽減剤からなる群から選択される少なくとも１種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種の成分とを含む除草用組成物。

【請求項１１】

(a) 請求項１に記載の化合物と、(b) (b 1) 光化学系ⅠⅠ阻害剤、(b 2) アセトヒドロキシ酸シンターゼ(AHAS)阻害剤、(b 3) アセチル-CoAカルボキシラーゼ(ACCase)阻害剤、(b 4) オーキシシン模倣体、(b 5) 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、(b 6) 光化学系Ⅰ電子ダイバータ、(b 7) プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼ(PPD)阻害剤、(b 8) グルタミンシンセターゼ(GS)阻害剤、(b 9) 超長鎖脂肪酸(VLCFA)エロンガーゼ阻害剤、(b 10) オーキシシン輸送阻害剤、(b 11) フィトエンデサチュラーゼ(PDS)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(HPPD)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(HST)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、アシュラム、プロモブチド、シンメシリン、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、オキサジクロメフォン、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(b 16) 除草剤薬害軽減剤；ならびに(b 1)～(b 16)の化合物の塩から選択される少なくとも１種の追加の有効成分とを含む除草用混合物。

【請求項１２】

望ましくない植生の成長を防除する方法であって、植生またはその環境に請求項１に記載の化合物の除草有効量を接触させることを含む、前記方法。