

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第4653307号  
(P4653307)

(45) 発行日 平成23年3月16日(2011.3.16)

(24) 登録日 平成22年12月24日(2010.12.24)

(51) Int.Cl.		F I	
AO 1 N 43/18	(2006.01)	AO 1 N 43/18	Z
AO 1 N 43/80	(2006.01)	AO 1 N 43/80	I O I
AO 1 N 25/32	(2006.01)	AO 1 N 25/32	
AO 1 N 41/06	(2006.01)	AO 1 N 41/06	
AO 1 N 47/30	(2006.01)	AO 1 N 47/30	E

請求項の数 6 (全 46 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2000-555495 (P2000-555495)	(73) 特許権者	302063961
(86) (22) 出願日	平成11年6月9日(1999.6.9)		バイエル・クロツプサイエンス・アクチエ ンゲゼルシヤフト
(65) 公表番号	特表2002-518416 (P2002-518416A)		ドイツ40789モンハイム・アルフレー ト・ノベル・シュトラッセ50
(43) 公表日	平成14年6月25日(2002.6.25)	(74) 代理人	100091731
(86) 国際出願番号	PCT/EP1999/003980		弁理士 高木 千嘉
(87) 国際公開番号	W01999/066795	(74) 代理人	100127926
(87) 国際公開日	平成11年12月29日(1999.12.29)		弁理士 結田 純次
審査請求日	平成18年5月31日(2006.5.31)	(74) 代理人	100105290
(31) 優先権主張番号	198 27 855.1		弁理士 三輪 昭次
(32) 優先日	平成10年6月23日(1998.6.23)	(74) 代理人	100080355
(33) 優先権主張国	ドイツ(DE)		弁理士 西村 公佑

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 除草剤と毒性緩和剤の結合

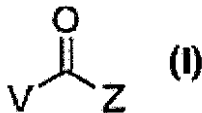
(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下のAおよびBの混合物を含む除草組成物。

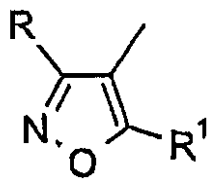
A. 下記式(I)の除草活性を有する化合物:

【化1】

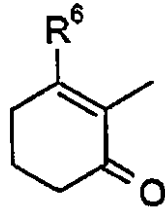


式中、Vは下記(V1)および(V3)から成る群から選ばれる基であり;

## 【化2】



(V1)



(V3)

10

(式中、記号およびインデックスは以下の意味を有する；

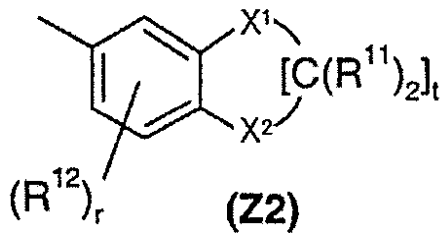
Rは水素であり；

R<sup>1</sup>はシクロプロピルであり；

R<sup>6</sup>はヒドロキシルである)；そして

Zは(Z2)の基である；

## 【化3】



(Z2)

20

(式中、記号およびインデックスは以下の意味を有する：

R<sup>11</sup>は水素であり；

R<sup>12</sup>はメチルであり；

rは2であり；

tは2であり；

X<sup>1</sup>はCHOCH<sub>3</sub>であり；

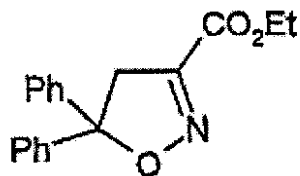
X<sup>2</sup>はSO<sub>2</sub>である；

ならびに

B. 下記a) ~ d) から成る群から選ばれる毒性緩和剤：

a) 下記式の化合物：

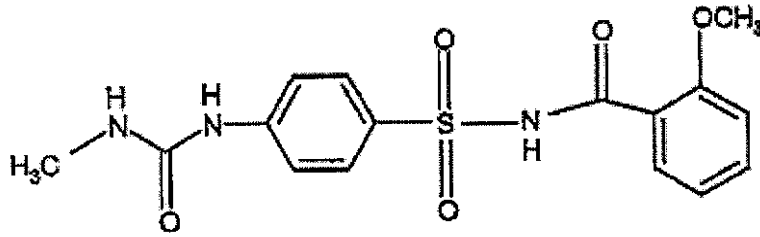
## 【化4】



40

b) 下記式の化合物：

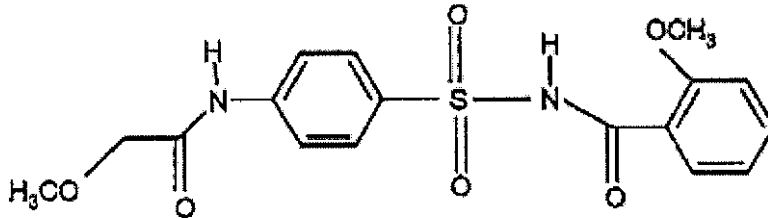
【化5】



c) 下記式の化合物：

10

【化6】

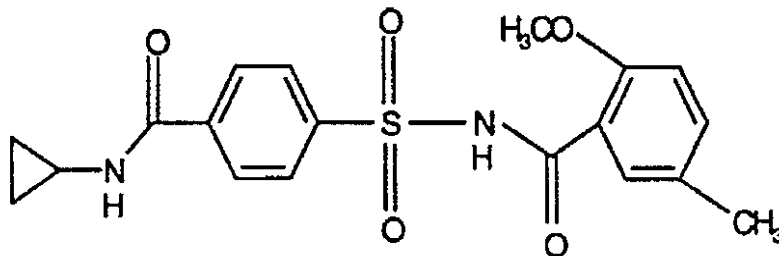


および

20

d) 下記式の化合物：

【化7】



30

【請求項2】

除草剤：毒性緩和剤の重量比が1：100から100：1である請求項1に記載の除草組成物。

【請求項3】

さらなる除草剤を含む請求項1または2に記載の除草組成物。

【請求項4】

請求項1から3のいずれかに記載の除草組成物を、有害な植物、有益な植物、前記植物の種子または前記植物が成育している領域に適用することからなる作物中の有害な植物を制御する方法。

40

【請求項5】

前記植物がトウモロコシ、コムギ、ライムギ、オオムギ、エンバク、コメ、モロコシ、綿花およびダイズから成る群から選ばれる、請求項4に記載の方法。

【請求項6】

前記植物が遺伝子工学によって操作されている請求項4または5に記載の方法。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明は、作物保護生成物、特に除草剤/解毒剤配合物(活性物質/毒性緩和剤配合物)であって、有用な植物の中で有害な植物が競合する場合の使用に極めて適している。

50

## 【 0 0 0 2 】

## 【従来技術】

p - ヒドロキシフェニルピルベートジオキシゲナーゼ (H P P D O) を抑制する最近の除草活性をもつ物質のいくつかは非常に有用な性状を有し、極めて低い使用割合で広範囲の細葉雑草および広葉雑草に対して使用できる (例えば以下を参照されたい: M.P. Prisbylla et al., Brighton Crop Protection Conference-Weeds(1993), 731-738)。

## 【 0 0 0 3 】

しかしながら、これらの極めて効果的な活性物質の多くは、いくつかの重要な作物 (例えばトウモロコシ、コメ、または穀類) に完全には適合しないので、それらの使用は厳密に制限される。ある種の作物では、したがってそれらを使用できないか、または有害な植物に対する所望の広範囲の除草効果が保証できない低い使用割合で用いられる。特に、上記の除草剤の多くは、トウモロコシ、コメ、穀類または他のいくつかの作物では有害な植物に対して完全には選択的に用いることができない。

## 【 0 0 0 4 】

これらの欠点を克服するために、いわゆる毒性緩和剤または解毒剤を配合して除草活性物質を使用することが知られている。本発明の目的のための毒性緩和剤は、有害植物に対する除草作用を実質的に低下させることなく、有用な植物に対する除草剤の植物毒性特性を代償するか、または低下させる化合物または化合物の混合物である。

W O 9 6 / 2 1 3 5 7 では、ある種の 4 - ベンゾイルイソオキサゾールおよび 2 - シアノ - 1, 3 - ジオンと種々の毒性緩和剤 (とりわけハロアルカン酸アミド、芳香族オキシムおよび 1, 8 - ナフタル酸無水物) との配合物が開示されている。E P - A 0 5 5 1 6 5 0 では、特定のベンゾイルシクロヘキサジオンと種々の毒性緩和剤とのいくつかの配合物が開示されている。E P - A 0 2 9 8 6 8 0 は、ベンゾイルシクロヘキサジオンとハロアルカン酸アミド、芳香族オキシム、チアゾールカルボン酸アミドおよび 1, 8 - ナフタル酸無水物から成る群から選ばれる毒性緩和剤とを含む混合物を記載している。

## 【 0 0 0 5 】

毒性緩和剤が除草剤の有害な作用を低下させる正確なメカニズムが分かっていないので、特定の種類の除草剤のための毒性緩和剤の特定は未だに困難な作業である。特定の除草剤と配合されるある化合物が毒性緩和剤として機能するという事実は、そのような化合物が他の種類の除草剤の毒性緩和剤としても作用するか否かについての答えにならない。したがって、有用な植物を除草剤の被害から保護するために毒性緩和剤を用いる場合、毒性緩和剤はなお多くの事例で多数の欠点を持つ可能性がある。これらは以下のようなものである:

- 毒性緩和剤は、有害な植物に対して除草剤の作用を低下させる、
- 有用植物保護特性は不十分である、
- ある除草剤と併用した場合、毒性緩和剤 / 除草剤を用いることができる有用な植物の範囲は十分には広くない、
- ある毒性緩和剤と併用できる除草剤の数は十分に多くはない。

## 【 0 0 0 6 】

## 【発明が解決しようとする課題】

本発明の目的は、上記の除草剤と併用した場合、重要な作物に対するこれら除草剤の選択性を高めるために適当である化合物を特定することである。

驚くべきことには、H P P D O 抑制物質として作用する特定の除草剤と一緒に重要な作物に対してこれら除草剤の選択性を高める一群の化合物を発見した。

## 【 0 0 0 7 】

## 【課題を解決するための手段】

したがって、本発明は、以下の物質、その立体異性体およびその塩 (農業で通常的に使用される塩を含める) の混合物からなる除草剤として活性な組成物に関する。

A . 除草剤として活性な量の下記式 (I) の 1 つまたは 2 つ以上の化合物:

## 【化 1 0 】

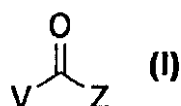
10

20

30

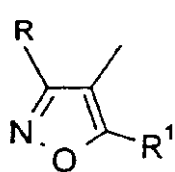
40

50

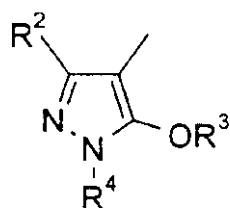


式中、Vは下記(V1)~(V4)から成る群から選ばれるラジカルであり；

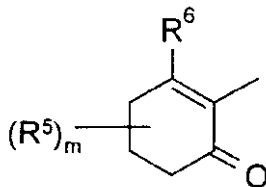
【化11】



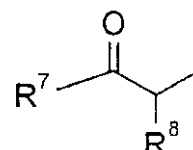
(V1)



(V2)



(V3)



(V4)

10

式中、記号およびインデックスは以下の意味を有する：

Rは水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルコキシカルボニル、COOH、シアノであり、好ましくは水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニルであり；

R<sup>1</sup>は水素または(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)炭素含有ラジカル、例えば(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>3</sub>-C<sub>7</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)シクロアルケニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)ハロシクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルチオシクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルケニルで、好ましくは(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)シクロアルキルであり；

20

R<sup>2</sup>は水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキル、ハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルコキシ、シアノ、ニトロ、好ましくは水素であり；

【0008】

R<sup>3</sup>は水素または(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)炭素含有ラジカル、例えば(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>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルカルボニル、(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>)ハロアルキルスルホニル、アリールスルホニル、アリールカルボニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、アリール-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、好ましくは水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、アリールスルホニル、ベンジルであり；

30

R<sup>4</sup>は水素または(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)炭素含有ラジカル、例えば(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、フェニル、ベンジル、好ましくは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルであり；

【0009】

R<sup>5</sup>は(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)炭素含有ラジカル、例えば(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ジアルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルチオ、ハロゲン、置換または非置換アリール、テトラヒドロピラン-4-イル、テトラヒドロピラン-3-イル、テトラヒドロチオピラン-3-イル、1-メチルチオ-シクロプロピル、2-エチルチオプロピル、好ましくは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシであり；

40

R<sup>6</sup>はヒドロキシルまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)炭素含有ラジカル、例えば(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルコキシ、ホルミルオキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルカルボニルオキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルスルホニルオキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルチオ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキルチオ、(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で、好ましくはヒドロキシル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシであり；

R<sup>7</sup>は(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)炭素含有ラジカル、例えば(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)ハロシクロアルキル、好ましくは(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)シクロアルキルであり；

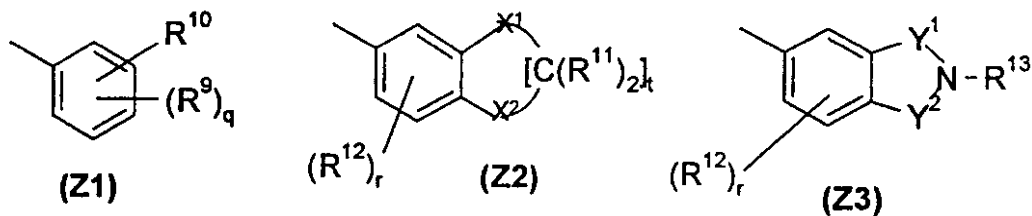
50

$R^8$ はシアノまたは( $C_1 - C_4$ )炭素含有ラジカル、例えば( $C_1 - C_4$ )アルコシカルボニル、( $C_1 - C_4$ )アルキルカルボニル、( $C_1 - C_4$ )アルキルスルホニル、( $C_1 - C_4$ )アルキルスルフィニル、( $C_1 - C_4$ )アルキルチオ、( $C_1 - C_4$ )アルキルアミノカルボニル、( $C_1 - C_4$ )ジアルキルアミノカルボニル、好ましくはシアノであり；  
 $m$ は0から6の整数であり、好ましくは0から3であり；そして

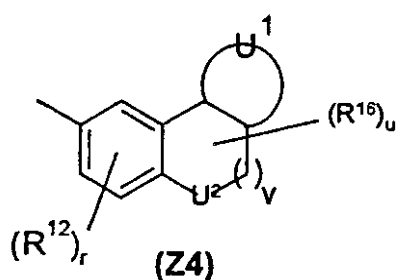
【0010】

Zは下記(Z1)~(Z4)から成る群から選ばれるラジカルであり、

【化12】



10



20

式中、記号およびインデックスは以下の意味を有する：

$R^9$ はニトロ、アミノ、ハロゲンまたは( $C_1 - C_8$ )炭素含有ラジカル、例えば( $C_1 - C_4$ )アルキル、( $C_2 - C_4$ )アルケニル、( $C_2 - C_4$ )アルキニル、( $C_1 - C_4$ )ハロアルキル、( $C_2 - C_4$ )ハロアルケニル、( $C_2 - C_4$ )ハロアルキニル、( $C_1 - C_4$ )ハロアルコキシ、( $C_1 - C_4$ )ハロアルキルチオ、( $C_1 - C_4$ )アルコシカルボニル、( $C_1 - C_4$ )アルキルスルホニル、( $C_1 - C_4$ )アルキルスルフィニル、( $C_1 - C_4$ )アルキルチオ、アリールスルホニル、アリールスルフィニル、アリールチオ、( $C_1 - C_4$ )アルコキシ、( $C_1 - C_4$ )アルコキシ-( $C_1 - C_4$ )アルコキシ、( $C_1 - C_4$ )アルキルカルボニル、( $C_1 - C_4$ )アルキルアミノスルホニル、( $C_1 - C_4$ )ジアルキルアミノスルホニル、( $C_1 - C_4$ )アルキルカルバモイル、( $C_1 - C_4$ )ジアルキルカルバモイル、( $C_1 - C_4$ )アルコキシ-( $C_1 - C_4$ )アルキル、フェノキシ、シアノ、アリール、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、好ましくは( $C_1 - C_4$ )アルキル、( $C_1 - C_4$ )ハロアルキル、( $C_1 - C_4$ )ハロアルコキシ、( $C_1 - C_4$ )アルキルスルホニル、( $C_1 - C_4$ )アルキルスルホニルオキシ、( $C_1 - C_4$ )アルキルスルホニルアミノ、( $C_1 - C_4$ )アルコシカルボニルであり；

30

【0011】

$R^{10}$ は置換または非置換ベンジル、置換または非置換ヘテロアリール、ヘテロシクリルで、好ましくはフラニル、チアゾリル、トリアゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、イソキサゾリニル、モルホリノおよびイミダゾリル；ヘテロアリール-( $C_1 - C_4$ )アルキル、好ましくはトリアゾリルメチル、ピラゾリルメチル、チアゾリルメチル、ジ( $C_1 - C_4$ )アルキルホスホノ-( $C_1 - C_4$ )アルキル、好ましくはジエチルホスホノメチル、ジメチルホスホノメチルまたは $SF_5$ であり；

40

$R^{11}$ は同一または異なり、水素、( $C_1 - C_4$ )アルキル、ハロゲン、好ましくは( $C_1 - C_4$ )アルキルであり；

$R^{12}$ は同一または異なり、( $C_1 - C_4$ )アルキル、( $C_2 - C_4$ )アルケニル、( $C_2 - C_4$ )アルキニル、ハロゲン、( $C_1 - C_4$ )ハロアルキル、( $C_2 - C_4$ )ハロアルケニル、( $C_2 - C_4$ )ハロアルキニル、( $C_1 - C_4$ )ハロアルコキシ、( $C_1 - C_4$ )ハロアルキルチオ、( $C_1 - C_4$ )アルコシカルボニル、( $C_1 - C_4$ )アルキルスルホニル、( $C_1 - C_4$ )ハロアルキルスルホニ

50

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>)ハロアルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルアミノスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ジアルキルアミノスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルカルバモイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ジアルキルカルバモイル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシアルキル、フェノキシ、ニトロ、シアノ、アリール、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルホスホノ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、好ましくは(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、ハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(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>)アルコキシカルボニルであり；

q は 0、1、2、3 または 4 であり；

r は 0、1、2 または 3 であり；

t は 1 または 2 であり；

u は 0、1 または 2 であり；

v は 1 または 2 であり；

【 0 0 1 2 】

X<sup>1</sup> は O、C R<sup>14</sup> R<sup>15</sup>、C H O H、C = O、C = N O (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルであり；

X<sup>2</sup> は O、S、S O、S O<sub>2</sub>、C H<sub>2</sub>、N H、N (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、N S O<sub>2</sub> (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、好ましくは S O<sub>2</sub> であり；

U<sup>1</sup> は連結された炭素原子と一緒にあって炭素環または複素環を形成し、これは芳香環または完全にもしくは部分的に飽和された、好ましくはピラゾール、イミダゾール、ピロール、ピリジン、ピリミジン、チアゾール、チエニル、オキサゾール、またはフラン環であり；

U<sup>2</sup> は O、S、S O、S O<sub>2</sub>、C H<sub>2</sub>、N H、N (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、N S O<sub>2</sub> (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、好ましくは S O<sub>2</sub> であり；

R<sup>13</sup> は水素、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキル、(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、場合によって置換されたフェニル、場合によって置換されたベンジル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アシルであり；

R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup> は同一または異なり、水素、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキルチオ、または R<sup>14</sup> と R<sup>15</sup> は一緒になって基 - O - (C H<sub>2</sub>)<sub>2</sub> - O -、- O - (C H<sub>2</sub>)<sub>3</sub> - O -、S - (C H<sub>2</sub>)<sub>2</sub> - S -、- S - (C H<sub>2</sub>)<sub>3</sub> - S -、- (C H<sub>2</sub>)<sub>4</sub> -、- (C H<sub>2</sub>)<sub>5</sub> - の 1 つを形成し；

R<sup>16</sup> は (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>)アルキルであり；

Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup> は、Y<sup>1</sup> Y<sup>2</sup> を条件として S O<sub>2</sub> または C O である；

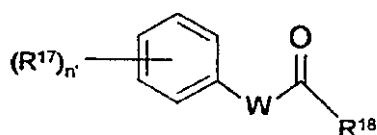
および

【 0 0 1 3 】

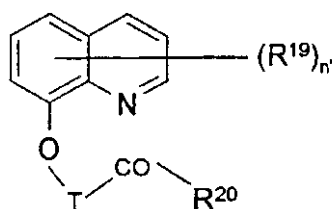
B . 解毒作用量の下記 a) ~ e) から成る群から選ばれる 1 つまたは 2 つ以上の化合物：

a) 下記式 (II) から (IV) の化合物、

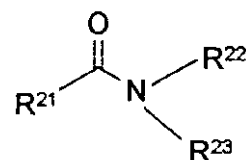
【 化 1 3 】



(II)



(III)



(IV)

式中、記号およびインデックスは以下の意味を有する：

n は 1 から 5 の自然数、好ましくは 1 から 3 であり；

T は (C<sub>1</sub> または C<sub>2</sub>) アルカンジイル鎖で、これは、置換されていないか、または 1 つもしくは 2 つの (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルラジカルによって、または [(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ] カルボニルによって置換されており；

10

20

30

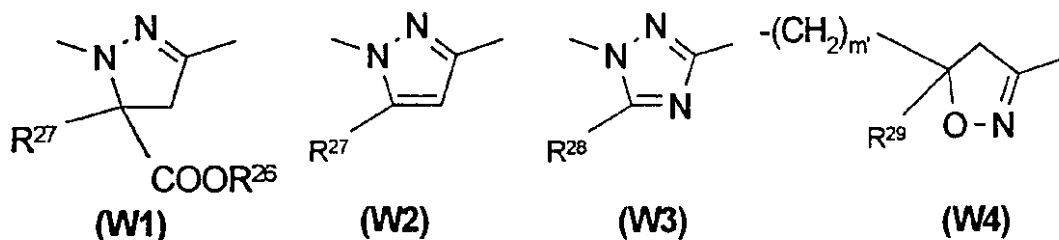
40

50

Wは置換されていないかまたは置換された二価の複素環ラジカル(部分的に不飽和であるかまたは芳香族である、NもしくはOのヘテロ原子1~3つを有する5員の複素環から成る群から選ばれ、前記環は少なくとも1つの窒素原子を含み、2つ以上の酸素原子を含まない)で、好ましくは以下の(W1)~(W4)から成る群から選ばれるラジカルで、

【0014】

【化14】



10

式中、m は0または1であり；

R<sup>17</sup>、R<sup>19</sup>は同一または異なり、水素、ハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ、ニトロ、または(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキルであり；

R<sup>18</sup>、R<sup>20</sup>は同一または異なり、OR<sup>24</sup>、SR<sup>24</sup>もしくはNR<sup>24</sup>R<sup>25</sup>または飽和もしくは不飽和の少なくとも1つの窒素原子および3つまでの異種原子をもつ3-から7-員複素環であってこれは(II)または(III)のカルボニル基に窒素原子を介して連結されており、さらにこれは置換されていないか、または(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ、または場合によって置換されたフェニルから成る群から選ばれるラジカルによって置換されているものであり、好ましくは式OR<sup>24</sup>、NHR<sup>25</sup>またはN(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>のラジカル、特に式OR<sup>24</sup>であり；

20

【0015】

R<sup>24</sup>は水素または非置換もしくは置換脂肪族炭化水素ラジカル、好ましくは合計1から18の炭素原子をもつものであり；

R<sup>25</sup>は水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシまたは置換もしくは非置換フェニルであり；

R<sup>26</sup>は水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)ハロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ヒドロキシアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)シクロアルキルまたはトリ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルシリルであり；

30

R<sup>27</sup>、R<sup>28</sup>、R<sup>29</sup>は同一または異なり、水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)ハロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)シクロアルキルまたは置換もしくは非置換フェニルであり；

R<sup>21</sup>は(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルケニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)シクロアルキル、好ましくはジクロロメチルであり；

R<sup>22</sup>、R<sup>23</sup>は同一または異なり、水素、(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>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルカルバモイル-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)アルケニルカルバモイル-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、ジオキサニル-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、チアゾリル、フリル、フリルアルキル、チエニル、ピペリジル、置換もしくは非置換フェニルであるか、または、R<sup>22</sup>およびR<sup>23</sup>は一緒になって置換もしくは非置換複素環、好ましくはオキサゾリジン、チアゾリジン、ピペリジン、モルホリン、ヘキサヒドロピリミジンまたはベンゾキサジン環を形成する；

40

または

【0016】

b) 下記から成る群からの1つまたは2つ以上の化合物：

1,8-ナフタル酸無水物、

メチルジフェニルメトキシアセテート、

シアノメトキシイミノ(フェニル)アセトニトリル(シオメトリニル)、

50

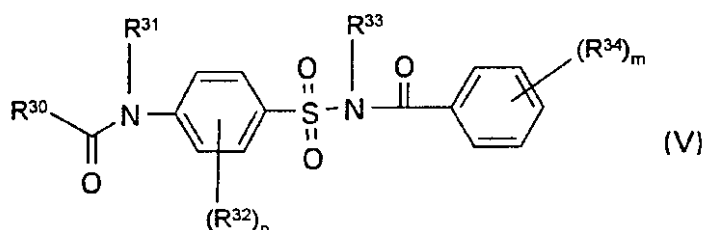


1,3 - ジオキソラン - 2 - イルメトキシイミノ(フェニル)アセトニトリル(オキサベトリニル)、  
 4 - クロロ - 2,2,2 - トリフルオロアセトフェノン O - 1,3 - ジオキソラン - 2 - イルメチルオキシム(フルキソフェニム)、  
 4,6 - ジクロロ - 2 - フェニルピリミジン(フェンクロリム)、  
 ベンジル - 2 - クロロ - 4 - トリフルオロメチル - 1,3 - チアゾール - 5 - カルボキシレート(フルラゾール)、  
 2 - ジクロロメチル - 2 - メチル - 1,3 - ジオキソラン(MG - 191)、  
 N - (4 - メチルフェニル) - N - (1 - メチル - 1 - フェニルエチル)尿素(ダイムロン)、  
 1 - [4 - (N - 2 - メトキシベンゾイルスルファモイル)フェニル] - 3 - メチル尿素、  
 1 - [4 - (N - 2 - メトキシベンゾイルスルファモイル)フェニル] - 3,3 - ジメチル尿素、  
 1 - [4 - (N - 4,5 - ジメチルベンゾイルスルファモイル)フェニル] - 3 - メチル尿素、  
 1 - [4 - (N - ナフトイルスルファモイル)フェニル] - 3,3 - ジメチル尿素、  
 (2,4 - ジクロロフェノキシ)酢酸(2,4 - D)、  
 (4 - クロロフェノキシ)酢酸、  
 (R,S) - 2 - (4 - クロロ - o - トリルオキシ)プロピオン酸(メコプロブ)、4 - (2,4 - ジクロロフェノキシ)酪酸(2,4 - DB)、  
 (4 - クロロ - o - トリルオキシ)酢酸(MCPA)、  
 4 - (4 - クロロ - o - トリルオキシ)酪酸、  
 4 - (4 - クロロフェノキシ)酪酸、  
 3,6 - ジクロロ - 2 - メトキシ安息香酸(ジカンバ)、  
 1 - (エトキシカルボニル)エチル 3,6 - ジクロロ - 2 - メトキシベンゾエート(ラクチジクロア)、  
 並びにそれらの塩およびエステル、好ましくは(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>) ;

【0017】

c) 下記式(V)のN - アシルスルホンアミドおよびそれらの塩 :

【化15】



式中、R<sup>30</sup>は水素、炭素含有ラジカル、例えば炭化水素ラジカル、炭化水素オキシラジカル、炭化水素チオラジカルまたはヘテロシクリルラジカルで、最後の4ラジカルの各々は、置換されていないか、またはハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、カルボキシル、フォルミル、カルボキサミド、スルホンアミドおよび式 - Z<sup>a</sup> - R<sup>a</sup>のラジカルから成る群から選ばれる同一または異なるラジカルの1つまたは2つ以上で置換されていて、

各炭化水素部分は好ましくは1から20の炭素原子をもち、さらに炭素含有ラジカルR<sup>30</sup>は好ましくは1から30の炭素原子をもつ置換基を含み ;

R<sup>31</sup>は水素または(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、好ましくは水素であるか、または

R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は式 - CO - N - の基と一緒に3から8員の飽和もしくは不飽和環のラジカルであり ;

R<sup>32</sup>は同一または異なり、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、カルボキ

10

20

30

40

50

シル、ホルミル、 $\text{CONH}_2$ 、 $\text{SO}_2\text{NH}_2$ または式 $-\text{Z}^b-\text{R}^b$ のラジカルであり；

$\text{R}^{33}$ は水素または $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ アルキル、好ましくはHであり；

$\text{R}^{34}$ は同一または異なり、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、カルボキシル、 $\text{CHO}$ 、 $\text{CONH}_2$ 、 $\text{SO}_2\text{NH}_2$ または式 $-\text{Z}^c-\text{R}^c$ のラジカルであり；

【0018】

$\text{R}^a$ は炭化水素ラジカルまたはヘテロシクリルラジカル(2つの最後に述べたラジカルの各々は置換されていないか、またはハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、モノおよびジ- $\{(\text{C}_1-\text{C}_4)$ アルキル $\}$ アミノから成る群から選ばれる同一または異なるラジカルの1つまたは2つ以上で置換されている)、またはアルキルラジカルであって、2つ以上、好ましくは2または3の非隣接 $\text{CH}_2$ 基は各々酸素原子で置換されており；

$\text{R}^b$ 、 $\text{R}^c$ は同一または異なり、炭化水素ラジカルまたはヘテロシクリルラジカル(最後の2つのラジカルの各々は非置換であるか、またはハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、ホスホリル、ハロ $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ アルコキシ、モノおよびジ $\{(\text{C}_1-\text{C}_4)$ アルキル $\}$ アミノから成る群から選ばれる1つまたは2つ以上の同一もしくは異なるラジカルによって置換されている)、またはアルキルラジカルで(このラジカルでは、2つ以上、好ましくは2つまたは3つの非隣接 $\text{CH}_2$ 基の各々が酸素原子で置換されている)；

$\text{Z}^a$ は式 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{CS}-$ 、 $-\text{CO}-\text{O}-$ 、 $-\text{CO}-\text{S}-$ 、 $-\text{O}-\text{C}-\text{O}-$ 、 $\text{S}-\text{CO}-$ 、 $-\text{SO}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{NR}^*-$ 、 $-\text{CO}-\text{NR}^*-$ 、 $-\text{NR}^*-\text{CO}-$ 、 $-\text{SO}_2-\text{NR}^*$ または $-\text{NR}^*-\text{SO}_2-$ の二価の基で、対象の二価の基の右側に示した結合はラジカル $\text{R}^a$ との結合で、さらに最後に述べた5ラジカルの $\text{R}^*$ はそれぞれ別個に各事例で、H、 $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ アルキルまたはハロ $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ アルキルであり；

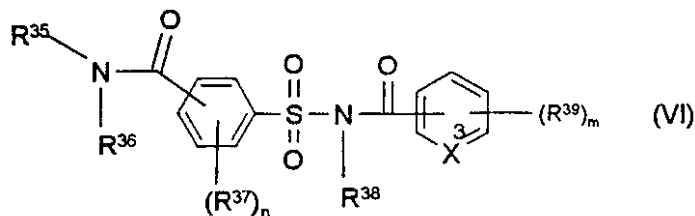
$\text{Z}^b$ 、 $\text{Z}^c$ はそれぞれ別個に直接結合または下記式の二価の基、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{CS}-$ 、 $-\text{CO}-\text{O}-$ 、 $-\text{CO}-\text{S}-$ 、 $-\text{O}-\text{CO}-$ 、 $-\text{S}-\text{CO}-$ 、 $-\text{SO}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{NR}^*-$ 、 $-\text{SO}_2-\text{NR}^*-$ 、 $-\text{NR}^*-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{CO}-\text{NR}^*$ または $-\text{NR}^*-\text{CO}-$ で、対象の二価の基の右側に示した結合はそれぞれラジカル $\text{R}^b$ または $\text{R}^c$ との結合で、最後の5ラジカルの $\text{R}^*$ はそれぞれ別個に各事例でH、 $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ アルキルまたはハロ $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ アルキルであり；

$n$ は0から4の整数で、好ましくは0、1または2、特に0または1であり；さらに、 $m$ は0から5の整数で、好ましくは0、1、2または3、特に0、1または2である；

【0019】

d) 下記式(VI)のアシルスルファモイルベンズアミド、適当な場合にはその塩：

【化16】



式中、 $\text{X}^3$ はCHまたはNであり；

$\text{R}^{35}$ は水素、ヘテロシクリルまたは炭化水素ラジカルで、最後の2つのラジカルは場合によって、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、カルボキシル、 $\text{CHO}$ 、 $\text{CONH}_2$ 、 $\text{SO}_2\text{NH}_2$ および $\text{Z}^a-\text{R}^a$ から成る群から選ばれる同一または異なるラジカルの1つまたは2つ以上で置換されており；

$\text{R}^{36}$ は水素、ヒドロキシル、 $(\text{C}_1-\text{C}_6)$ アルキル、 $(\text{C}_2-\text{C}_6)$ アルケニル、 $(\text{C}_2-\text{C}_6)$ アルキニル、 $(\text{C}_1-\text{C}_6)$ アルコキシ、 $(\text{C}_2-\text{C}_6)$ アルケニルオキシで、最後の5つのラジカルは場合によって、ハロゲン、ヒドロキシル、 $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ アルキル、 $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ アルコキシおよび $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ アルキルチオから成る群から選ばれる同一または異なる1つもしくは2つ以上のラジカルによって置換されているか；または

【0020】

$\text{R}^{35}$ および $\text{R}^{36}$ は、それらが結合している窒素原子と一緒に3から8員の飽和また

10

20

30

40

50

は不飽和環を形成し；

$R^{37}$ はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、カルボキシル、 $CHO$ 、 $CONH_2$ 、 $SO_2NH_2$ また $Z^b - R^b$ であり；

$R^{38}$ は水素、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ アルケニルまたは $(C_2 - C_4)$ アルキニルであり；

$R^{39}$ はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、カルボキシル、ホスホリル、 $CHO$ 、 $CONH_2$ 、 $SO_2NH_2$ または $Z^c - R^c$ であり；

$R^a$ は $(C_2 - C_{20})$ アルキルラジカルでありその炭素鎖は1回または2回以上酸素原子によって中断されているか、またはヘテロシクリルもしくは炭化水素ラジカルであり、最後の2つのラジカルは場合によって、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、モノおよびジ〔 $(C_1 - C_4)$ アルキル〕アミノから成る群から選ばれる1つまたは2つ以上の同一または異なるラジカルで置換されており；

$R^b$ 、 $R^c$ は同一または異なり、 $(C_2 - C_{20})$ アルキルラジカルでありその炭素鎖は1回または2回以上酸素原子によって中断されているか、またはヘテロシクリルもしくは炭化水素ラジカルであり、最後の2つのラジカルは場合によって、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシル、ホスホリル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、モノおよびジ〔 $(C_1 - C_4)$ アルキル〕アミノから成る群から選ばれる1つまたは2つ以上の同一または異なるラジカルで置換されており；

$Z^a$ は、 $O$ 、 $S$ 、 $CO$ 、 $CS$ 、 $C(O)O$ 、 $C(O)S$ 、 $SO$ 、 $SO_2$ 、 $NR^d$ 、 $C(O)NR^d$ または $SO_2NR^d$ から成る群から選ばれる二価ユニットであり；

$Z^b$ 、 $Z^c$ は同一または異なり、直接結合または $O$ 、 $S$ 、 $CO$ 、 $CS$ 、 $C(O)O$ 、 $C(O)S$ 、 $SO$ 、 $SO_2$ 、 $NR^d$ 、 $SO_2NR^d$ または $C(O)NR^d$ から成る群から選ばれる二価ユニットであり；

$R^d$ は水素、 $(C_1 - C_4)$ アルキルまたは $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルであり；

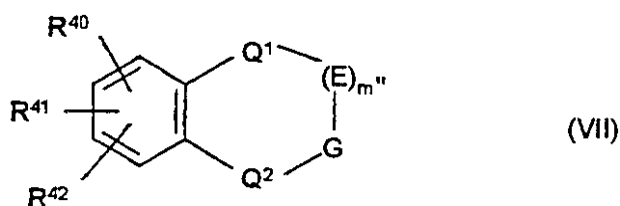
$n$ は0から4の整数であり；さらに

$m$ は、 $X$ が $CH$ である場合は0から5の整数で、 $X$ が $N$ である場合は0から4の整数である；

【0021】

e) 下記式(VII)の化合物、

【化17】



式中、記号およびインデックスは以下の意味を有し：

$R^{40}$ は $H$ 、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキル -  $X^4$ もしくは $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル -  $X^4$ で置換された $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $NO_2$ 、 $CN$ 、 $-COO - R^{43}$ 、 $NR_2^{44}$ 、 $SO_2NR_2^{45}$ または $CONR_2^{46}$ であり；

$R^{41}$ は $H$ 、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $CF_3$ 、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシまたは $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシであり；

$R^{42}$ は $H$ 、ハロゲンまたは $(C_1 - C_4)$ アルキルであり；

$Q^1$ 、 $Q^2$ 、 $E$ 、 $G$ は同一または異なり、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-CR_2^{47}-$ 、 $-CO-$ 、 $NR^48$ または下記式(VIII)の基であるが；

$C = CH - O - CR_2^a - (CO) - A$  (VIII)

ただし、

a) 基 $Q^1$ 、 $Q^2$ 、 $E$ 、 $G$ の少なくとも1つがカルボニル基で、これらの基の1つは正確に式(VIII)のラジカルで、式(VIII)の基はカルボニル基に隣接し、さらに

b) 2つの隣接する基 $Q^1$ 、 $Q^2$ 、E、Gは同時に酸素であることはない、  
とし；

【0022】

$R^a$ は同一または異なり、Hまたは $(C_1 - C_8)$ アルキル、または2つのラジカル $R^a$ はともに $(C_2 - C_6)$ アルキレンであり；

Aは、 $R^b - Y^3$  - または  $-NR_2^{49}$  であり；

$X^4$ は、 $-O-$  または  $-S(O)_p-$  であり；

$Y^3$ は、 $-O-$  または  $-S-$  であり；

$R^b$ はH、 $(C_1 - C_8)$ アルキル、 $(C_1 - C_8)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ $(C_1 - C_8)$ アルキル、 $(C_3 - C_6)$ アルケニルオキシ $(C_1 - C_8)$ アルキル、またはフェニル $(C_1 - C_8)$ アルキル(フェニル環は場合によって、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $CF_3$ 、メトキシまたはメチル- $S(O)_p$ で置換される)、 $(C_3 - C_6)$ アルケニル、 $(C_3 - C_6)$ ハロアルケニル、フェニル $(C_3 - C_6)$ アルケニル、 $(C_3 - C_6)$ アルキニル、フェニル $(C_3 - C_6)$ アルキニル、オキサタニル、フルフリル、テトラヒドロフリルであり；

$R^{43}$ は、Hまたは $(C_1 - C_4)$ アルキルであり；

$R^{44}$ は同一または異なり、H、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニルまたは2つのラジカル $R^{44}$ はともに $(C_4 - C_5)$ アルキレンであり；

$R^{45}$ 、 $R^{46}$ はそれぞれ別個に各事例で同一または異なり、H、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、または2つのラジカル $R^{45}$ および/または $R^{46}$ はともに $(C_4 - C_5)$ アルキレンであり、1つの $CH_2$ 基はOもしくはSで置換されていてもよく、または1つまたは2つの $CH_2$ 基はN  
 $R^c$ によって置換されていてもよく；

【0023】

$R^c$ は、Hまたは $(C_1 - C_8)$ アルキルであり；

$R^{47}$ は同一または異なり、H、 $(C_1 - C_8)$ アルキルであるか、または2つのラジカル $R^{47}$ はともに $(C_2 - C_6)$ アルキレンであり；

$R^{48}$ はH、 $(C_1 - C_8)$ アルキル、置換もしくは非置換フェニル、またはベンジルで、これは置換されていなくてもフェニル環上で置換されていてもよく；

$R^{49}$ は同一または異なり、H、 $(C_1 - C_8)$ アルキル、フェニル、フェニル $(C_1 - C_8)$ アルキル(ここでフェニル環はF、Cl、Br、 $NO_2$ 、CN、 $OCH_3$ 、 $(C_1 - C_4)$ アルキルまたは $CH_3SO_2$ で置換されていてもよい)、または $(C_1 - C_4)$ アルコキシ- $(C_1 - C_8)$ アルキル、 $(C_3 - C_6)$ アルケニル、 $(C_3 - C_6)$ アルキニル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキルであるか、または2つのラジカル $R^{49}$ はともに $(C_4 - C_5)$ アルキレンで、1つの $CH_2$ 基はOまたはSで置換されていてもよく、または1つもしくは2つの $CH_2$ 基は $-NR^d-$ で置換されていてもよく；

$R^d$ は、Hまたは $(C_1 - C_4)$ アルキルであり；

m は0または1であり；そして

pは0、1または2である。

【0024】

本発明で除草剤として有効な量とは、不利な影響を植物の成長に与えるために適当な1つまたは2つ以上の除草剤の量を意味する。

本発明で解毒剤として有効な量とは、有用な植物に対する除草剤または除草剤混合物の植物毒性作用と少なくとも部分的に対抗するために適当な1つまたは2つ以上の毒性緩和剤の量を意味する。

また別に特に規定されないかぎり、以下の定義は一般に式(I)から(VIII)およびそれに続く式のラジカルに適用される。

炭素骨格中のラジカル、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、アルキルアミノおよびアルキルチオ並びに対応する不飽和および/または置換ラジカルは、各々直鎖でも分子鎖でもよい。

【0025】

アルキルラジカル(複合物の意味でも、例えばアルコキシ、ハロアルキルなど)は、好まし

10

20

30

40

50

くは1つ～4つの炭素原子を有し、例えば、メチル、エチル、*n*もしくは*i*-プロピル、*n*-、*i*-、*t*-もしくは2-ブチルである。アルケニルおよびアルキニルラジカルは可能な不飽和ラジカルの意味を有し、それらはアルキルラジカルに対応し、アルケニルは、例えばアリル、1-メチルプロパ-2-エン-1-イル、2-メチルプロパ-2-エン-1-イル、ブタ-2-エン-1-イル、ブタ-3-エン-1-イル、1-メチルブタ-3-エン-1-イルおよび1-メチルブタ-2-エン-1-イルである。アルキニルは、例えばプロパルギル、ブタ-2-イン-1-イル、ブタ-3-イン-1-イル、1-メチルブタ-3-イン-1-イルである。“(*C*<sub>1</sub>-*C*<sub>4</sub>)-アルキル”は、1つ～4つの炭素原子を有するアルキルの略語で、これはまた、考えられる炭素原子数の範囲が括弧内に示される他の一般的なラジカルの定義に同じように適用される。

10

## 【0026】

シクロアルキルは、3～8、好ましくは3～7、特に好ましくは3～6の炭素原子を有する環状アルキルラジカルが好ましく、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ルである。シクロアルケニルおよびシクロアルキニルは対応する不飽和化合物を指す。

## 【0027】

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素である。ハロアルキル、ハロアルケニルおよびハロアルキニルは、部分的または完全にハロゲン、好ましくはフッ素、塩素および/または臭素、特にフッ素または塩素で置換されたアルキル、アルケニルまたはアルキニルで、例えばCF<sub>3</sub>、CHF<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>F、CF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>FCHCl、CCl<sub>3</sub>、CHCl<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Clである。ハロアルコキシは、例えばOCF<sub>3</sub>、OCHF<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>F、CF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>O、OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>およびOCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Clである。これはまた他のハロゲン置換ラジカルにも同じように適用される。

20

## 【0028】

一般に、脂肪族炭化水素ラジカルは、直鎖または分枝した飽和もしくは不飽和炭化水素ラジカルで、好ましくは1～18、特に好ましくは1～12の炭素原子を有し、例えばアルキル、アルケニルまたはアルキニルである。一般に、アリアルは、好ましくは6～14の炭素原子を有する単環式、二環式または多環式芳香族系で、好ましくはフェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、インデニル、インダニル、ペンタレニルおよびフルオレニルで、特に好ましくはフェニルである。

30

## 【0029】

脂肪族炭化水素ラジカルは、好ましくは、12までの炭素原子をもつアルキル、アルケニルまたはアルキニルを意味し、これはまたハイドロカーボンオキシラジカルの脂肪族炭化水素ラジカルにも同じように適用される。

## 【0030】

複素環、複素環ラジカルまたはヘテロシクリルとは、単環、二環または多環式系を指し、これは飽和、不飽和および/または芳香族で、好ましくはN、SおよびOから成る群から選ばれる1つまたは2つ以上の、好ましくは1つ～4つの異種原子を有する。好ましいものは、飽和複素環で3つ～7つの環原子およびN、OおよびSから成る群から選ばれる1つまたは2つの異種原子を有し、カルコゲンは隣接しない。特に好ましいものは、3つ～7つの環原子およびN、OおよびSから成る群から選ばれる1つの異種原子をもつ単環で、モルホリン、ジオキサラン、ピペラジン、イミダゾリンおよびオキサゾリジンである。極めて好ましい飽和複素環はオキシラン、ピロリドン、モルホリンおよびテトラヒドロフランである。

40

## 【0031】

また好ましいものは、部分的に不飽和の複素環で、5つ～7つの環原子およびN、OおよびSから成る群から選ばれる1つまたは2つの異種原子を有する。特に好ましいものは、部分的に不飽和の複素環で、5つ～6つの環原子およびN、OおよびSから成る群から選ばれる1つの異種原子を有する。

極めて好ましい部分的に不飽和の複素環はピラゾリン、イミダゾリンおよびイソキサゾリ

50

ンである。

【0032】

また好ましいものは、N、O、Sから成る群から選ばれる1つ～4つの異種原子を含み、カルコゲンは隣接しない、5つから6つの環原子をもつ単環式または二環式芳香族複素環である。特に好ましいものは、単環式芳香族複素環で5つ～6つの環原子およびN、OおよびSから成る群から選ばれる1つの異種原子を含み、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン、オキサゾール、チアジアゾール、オキサジアゾール、ピラゾール、トリアゾールおよびイソキサゾールである。極めて好ましいものは、ピラゾール、チアゾール、トリアゾールおよびフランである。

【0033】

置換ラジカル、例えば置換炭化水素ラジカル、例えば置換アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、フェニルおよびアリールアルキル(例えばベンジル)、または置換ヘテロシクリルもしくはヘテロアリールは、非置換骨格に由来する置換ラジカルで、置換基は、好ましくは1つまたは2つ以上、好ましくは1つ、2つまたは3つ(C1およびFの場合には可能な最大数)の以下から成る群から選ばれる：ハロゲン、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、ヒドロキシル、アミノ、ニトロ、カルボキシル、シアノ、アジド、アルコシカルボニル、アルキルカルボニル、ホルミル、カルバモイル、モノおよびジアルキルアミノカルボニル、置換アミノ(例えばアシルアミノ、モノおよびジアルキルアミノ)、およびアルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、さらに環状ラジカルの場合にはさらにアルキルおよびハロアルキル、および上記の飽和炭化水素含有ラジカルに対応する不飽和脂肪族ラジカル、好ましくはアルケニル、アルキニル、アルケニルオキシ、アルキニルオキシである。炭素原子をもつラジカルの場合には、これらのラジカルは1つ～4つの炭素原子、特に1つまたは2つの炭素原子をもつものが好ましい、一般的に好ましいものは、ハロゲン(例えばフッ素または塩素)、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル(好ましくはメチルまたはエチル)、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキル(好ましくはトリフルオロメチル)、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ(好ましくはメトキシまたはエトキシ)、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルコキシ、ニトロおよびシアノから成る群から選ばれる置換基である。特に好ましい置換基はメチル、メトキシおよび塩素である。

【0034】

一置換または二置換アミノは、例えばアルキル、アルコキシ、アシルおよびアリールから成る群から選ばれる1つまたは2つの同一または異なるラジカルによってN-置換されている置換アミノラジカルから成る群から選ばれる化学的に安定なラジカルを意味し、好ましくはモノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アシルアミノ、アリールアミノ、N-アルキル-N-アリルアミノおよびN-複素環である。1つ～4つの炭素原子をもつアルキルラジカルが好ましい。アリールは好ましくはフェニルまたは置換フェニルである。アシルに関する限り、下記に示す定義がさらに適用され、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルカノイルが好ましい。これはまた置換ヒドロキシルアミノまたはヒドラジノにも同じように適用される。

【0035】

好ましくは、場合によって置換されるフェニルは、非置換であるか、または下記から成る群から選ばれる同一または異なるラジカルで一置換もしくは多置換されているか(好ましくは三置換まで)、ハロゲン(例えばC1およびF)の場合は五置換まで置換されているフェニルである：(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルコキシおよびニトロ、例えばo-、m-およびp-トリル、ジメチルフェニル、2-、3-および4-クロロフェニル、2-、3-および4-トリフルオロ並びに-トリクロロフェニル、2,4-、3,5-、2,5-および2,3-ジクロロフェニル、o-、m-およびp-メトキシフェニル。

【0036】

アシルラジカルは、好ましくは6までの炭素原子を有する有機酸のラジカルを意味し、例えばカルボン酸のラジカルおよびそれらに由来する酸、例えばチオカルボン酸、場合によってN-置換されたイミノカルボン酸のラジカル、またはカルボン酸モノエステル(場合

10

20

30

40

50

によってN - 置換されているカルバミン酸、スルホン酸、スルフィン酸、ホスホン酸、ホスフィン酸)のラジカルである。アシルは、例えばホルミル、アルキルカルボニル、例えば(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル)カルボニル、フェニルカルボニル(フェニル環が、例えばフェニルについて上記に示したように置換されていてもよい)、またはアルキルカルボニル、フェニルオキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、アルキルスルホニル、アルキルスルフィニルまたはN - アルキル - 1 - イミノアルキルである。

【0037】

式(I) ~ (VIII)はまた、その原子が同じ局所構造結合を有する全ての立体異性体、およびこれらの立体異性体の混合物をも包含する。そのような化合物は、1つまたは2つ以上の不整炭素原子、または、式の中で特に記述されていない二重結合も含んでいる。それらの特定の立体的形状によって規定される可能な立体異性体、例えば鏡像異性体、ジアステレオマー、Z - およびE - 異性体は、立体異性体混合物から通常の方法によって得ることができ、また別には立体化学的に純粋な出発物質を使用しながら立体特異的反応によって得ることもできる。

10

【0038】

本発明の適当な除草活性を有する物質は式(I)の化合物であるが、それらは穀類作物および/またはトウモロコシに対して有害すぎるので、穀類作物および/またはトウモロコシの場合には単独では用いることができないか、または単独では最適な状態で用いることができない。

【0039】

式(I)の除草剤は例えば以下で開示されている：

EP - A 0 496 631、WO - A 97 / 13 765、  
 WO - A 97 / 01 550、WO - A 97 / 19 087、  
 WO - A 96 / 30 368、WO - A 96 / 31 507、  
 WO - A 96 / 26 192、WO - A 96 / 26 206、  
 WO - A 96 / 10 561、WO - A 96 / 05 183、  
 WO - A 96 / 05 198、WO - A 96 / 05 197、  
 WO - A 96 / 05 182、WO - A 97 / 23 491および  
 WO - A 97 / 27 187。

20

上記の引用文献は製造方法および出発材料について広範囲の情報を含む。これらの文献は参照により本明細書に含まれる。

30

【0040】

式(II)の化合物は、例えばEP - A - 0 333 131(ZA - 89 / 1960)、EP - A - 0 269 806(US - A - 4,891,057)、EP - A - 0 346 620(AU - A - 89 / 34951)、EP - A - 0 174 562、EP - A - 0 346 620(WO - A - 91 / 08 202)、WO - A - 91 / 07 874またはWO - A 95 / 07 897(ZA 94 / 7120)およびそれら明細書中に引用された文献に開示されており、またそれらに記載されている方法と同じように製造できる。式(III)の化合物は、EP - A - 0 086 750、EP - A - 0 94349(US - A - 4,902,340)、EP - A - 0 191736(US - A - 4,881,966)およびEP - A - 0 49 2 366並びにそれらで引用されている文献に開示されており、またそれらに記載されている方法と同じように製造できる。いくつかの化合物は、さらにEP - A - 0 582 198に記載されている。

40

【0041】

式(II)の化合物は多数の特許出願、例えばUS - A - 4,021,224およびUS - A - 4,021,229に開示されている。群(b)の化合物はさらにCN - A - 87 / 102 789、EP - A - 365484から、並びに“The Pesticide Manual”(The British Crop Protection Council and the Royal Society of Chemistry, 11th edition, Farnham 1997)から知ることができる。

【0042】

50

群(c)の化合物はWO - A - 97 / 45016に、群(d)の化合物はドイツ特許出願19742951.3に、群(e)の化合物はWO - A 98 / 13361に記載されている。引用した文献は製造方法および出発材料について広範囲の情報を含んでいる。これらの文献は参照により本明細書に含まれる。

【0043】

好ましい除草剤/毒性緩和剤配合物は、式(II)および/または(III)(その中の記号およびインデックスは以下の意味を有する)の毒性緩和剤を含むものである：

R<sup>24</sup>は水素、(C<sub>1</sub> - C<sub>18</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>12</sub>)シクロアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>)アルケニルおよび(C<sub>2</sub> - C<sub>18</sub>)アルキニルで、炭素含有基が1つまたは2つ以上の、好ましくは3つまでのラジカルR<sup>50</sup>によって置換されていてもよく；

R<sup>50</sup>は同一または異なり、ハロゲン、ヒドロキシル、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキルチオ、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>)アルケニルチオ、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>)アルキニルチオ、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>)アルケニルオキシ、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>)アルキニルオキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルコキシ、シアノ、モノおよびジ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルアミノ、カルボキシル、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルコキシカルボニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>)アルケニルオキシカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキルチオカルボニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>)アルキニルオキシカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキルカルボニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>)アルケニルカルボニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>)アルキニルカルボニル、1 - (ヒドロキシイミノ) - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、1 - [(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルイミノ] (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、1 - [(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシイミノ] (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>)アルケニルカルボニルアミノ、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>)アルキニルカルボニルアミノ、アミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノカルボニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルケニルアミノカルボニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルキニルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルコキシカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキルアミノカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルオキシで、これらは置換されていないか、またはR<sup>51</sup>によって置換されていてもよく、R<sup>51</sup>は、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルケニルカルボニルオキシ、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルキニルカルボニルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキルスルホニル、フェニル、フェニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、フェニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル、フェノキシ、フェノキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、フェノキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル、フェニルカルボニルオキシ、フェニルカルボニルアミノ、フェニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルアミノで、最後の9ラジカルは置換されていなくてもよく、または、フェニル環が以下のラジカルR<sup>52</sup>によって、またはR O - CHR C H C O R - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシによって一置換もしくは多置換(好ましくは三置換まで)されていてもよく、R<sup>52</sup>はSiR<sub>3</sub>、-O-SiR<sub>3</sub>、R<sub>3</sub>Si-(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルコキシ、-CO-O-NR<sub>2</sub>、-O-N=CR<sub>2</sub>、-N=CR<sub>2</sub>、-O-NR<sub>2</sub>、-NR<sub>2</sub>、CH(OR)<sub>2</sub>、-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-CH(OR)<sub>2</sub>、-CR(OR)<sub>2</sub>、-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CR(OR)<sub>2</sub>であり；

【0044】

R<sup>51</sup>は同一または異なり、ハロゲン、ニトロ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシおよびフェニルで、これは置換されていないか、または1つまたは2つ以上、好ましくは3つまでのラジカルR<sup>52</sup>で置換されており；

R<sup>52</sup>は同一または異なり、ハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルコキシまたはニトロであり；

R は同一または異なり、ハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、フェニルでこれは置換されていないか、または1つまたは2つ以上、好ましくは3つまでのラジカルR<sup>52</sup>で置換されており、または2つのラジカルR は一緒になって(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンジイル鎖を形成し；

R は同一または異なる(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルであるか、または2つのラジカルR は一緒になって(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンジイル鎖を形成し；

R は水素または(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルであり；

mは0、1、2、3、4、5または6である。

【0045】

10

20

30

40

50



本発明の特に好ましい除草剤/毒性緩和剤配合物は、式(II)および/または(III)(式中、記号およびインデックスは下記の意味を有する)の毒性緩和剤を含む：

$R^{24}$ は水素、 $(C_1 - C_8)$ アルキルまたは $(C_3 - C_7)$ シクロアルキルであり、上記の炭素含有基は置換されていないか、またはハロゲンによって一置換もしくは多置換されているか、またはラジカル $R^{50}$ によって一置換もしくは二置換(好ましくは一置換)されている；

【0046】

$R^{50}$ は同一または異なり、ヒドロキシル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、カルボキシル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシカルボニル、 $(C_2 - C_6)$ アルケニルオキシカルボニル、 $(C_2 - C_6)$ アルキニルオキシカルボニル、1-(ヒドロキシイミノ)- $(C_1 - C_4)$ アルキル、1-[( $C_1 - C_4$ )アルキルイミノ] $(C_1 - C_4)$ アルキル、1-[( $C_1 - C_4$ )アルコキシイミノ] $(C_1 - C_4)$ アルキル； $SiR_3$ 、 $-O-N=CR_2$ 、 $-N=CR_2$ 、 $-NR_2$ および $-O-NR_2$ で、式中、 $R$ は同一または異なり、水素、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、または対として $(C_4 - C_5)$ アルカンジイル鎖であり；

$R^{27}$ 、 $R^{28}$ 、 $R^{29}$ は同一または異なり、水素、 $(C_1 - C_8)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル、またはフェニルで、これは置換されていないか、またはハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、モノおよびジ[( $C_1 - C_4$ )アルキル]アミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオおよび $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニルから成る群から選ばれる1つまたは2つ以上のラジカルによって置換されており；

$R^{26}$ は水素、 $(C_1 - C_8)$ アルキル、 $(C_1 - C_8)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ ヒドロキシアルキル、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキルまたはトリ $(C_1 - C_4)$ アルキルシリルであり；

$R^{17}$ 、 $R^{19}$ は同一または異なり、水素、ハロゲン、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、 $(C_1$ または $C_2)$ ハロアルキル、好ましくは水素、ハロゲンまたは $(C_1$ または $C_2)$ ハロアルキルである。

【0047】

極めて好ましい毒性緩和剤は、式(II)の記号およびインデックスが下記の意味を有するものである：

$R^{17}$ は水素、ハロゲン、ニトロまたは $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルであり；

$n$ は1、2または3であり；

$R^{18}$ は式 $OR^{24}$ のラジカルであり；

$R^{24}$ は水素、 $(C_1 - C_8)$ アルキルまたは $(C_3 - C_7)$ シクロアルキルであり、上記の炭素含有基は置換されていないか、または一置換もしくは多置換されており、同一もしくは異なるハロゲンラジカルによって好ましくは三置換まで、または以下から群から選ばれる同一もしくは異なるラジカルによって二置換まで、好ましくは一置換されており：ヒドロキシル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシカルボニル、 $(C_2 - C_6)$ アルケニルオキシカルボニル、 $(C_2 - C_6)$ アルキニルオキシカルボニル、1-(ヒドロキシイミノ)- $(C_1 - C_4)$ アルキル、1-[( $C_1 - C_4$ )アルキルイミノ] $(C_1 - C_4)$ アルキル、1-[( $C_1 - C_4$ )アルコキシイミノ] $(C_1 - C_4)$ アルキルおよび以下の式のラジカル $SiR_3$ 、 $-O-N=CR_2$ 、 $-N=CR_2$ 、 $-NR_2$ および $-O-NR_2$ であり、上記の式中、 $R$ は同一または異なり、水素、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、または対として $(C_4$ または $C_5)$ アルカンジイルであり；

【0048】

$R^{27}$ 、 $R^{28}$ 、 $R^{29}$ は同一または異なり、水素、 $(C_1 - C_8)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル、またはフェニルで、これは置換されていないか、またはハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、ニトロ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルおよび $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシから成る群から選ばれる1つまたは2つ以上のラジカルによって置換されており；

$R^{26}$ は水素、 $(C_1 - C_8)$ アルキル、 $(C_1 - C_8)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ ヒドロキシアルキル、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキルまたは

10

20

30

40

50

トリ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルシリルである。

【0049】

きわめて好ましい毒性緩和剤はまた、記号およびインデックスが下記の意味を有する式(II)の物質である：

R<sup>19</sup>は水素、ハロゲンまたは(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキルであり；

n は1、2または3で、ここで(R<sup>19</sup>)<sub>n</sub> は好ましくは5 - C<sub>1</sub>であり；

R<sup>20</sup>は式OR<sup>24</sup>のラジカルであり；

TはCH<sub>2</sub>であり；さらに

R<sup>24</sup>は水素、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)ハロアルキルまたは(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルであり、好ましくは(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキルである。

10

【0050】

特に好ましいものは、記号およびインデックスが以下の意味をもつ式(II)の毒性緩和剤である：

Wは(W1)であり；

R<sup>17</sup>は水素、ハロゲンまたは(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>)ハロアルキルであり；

n は1、2または3で、ここで(R<sup>17</sup>)<sub>n</sub> は好ましくは2, 4 - C<sub>12</sub>であり；

R<sup>18</sup>は式OR<sup>24</sup>のラジカルであり；

R<sup>24</sup>は水素、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ヒドロキシアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルまたはトリ(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>)アルキルシリルで、好ましくは(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルであり；

20

R<sup>27</sup>は水素、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキルまたは(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルで、好ましくは水素または(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルであり；

R<sup>26</sup>は水素、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ヒドロキシアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルまたはトリ(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>)アルキルシリルで、好ましくは水素または(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルである。

【0051】

また、特に好ましいものは、記号およびインデックスが以下の意味をもつ式(II)の毒性緩和剤を含む除草剤組成物である：

Wは(W2)であり；

R<sup>17</sup>は水素、ハロゲンまたは(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>)ハロアルキルであり；

n は1、2または3で、(R<sup>17</sup>)<sub>n</sub> は好ましくは2, 4 - C<sub>12</sub>であり；

R<sup>18</sup>は式OR<sup>24</sup>のラジカルであり；

R<sup>24</sup>は水素、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ヒドロキシアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルまたはトリ(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>)アルキルシリルで、好ましくは(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルであり；さらに

30

R<sup>27</sup>は水素、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルまたはフェニルで、好ましくは水素または(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルである。

【0052】

また、特に好ましいものは、記号およびインデックスが以下の意味をもつ式(II)の毒性緩和剤である：

40

Wは(W3)であり；

R<sup>17</sup>は水素、ハロゲンまたは(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>)ハロアルキルであり；

n は1、2または3で、(R<sup>17</sup>)<sub>n</sub> が好ましくは2, 4 - C<sub>12</sub>であり；

R<sup>18</sup>は式OR<sup>24</sup>のラジカルであり；

R<sup>24</sup>は水素、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ヒドロキシアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルまたはトリ(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>)アルキルシリルで、好ましくは(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルであり；さらに

R<sup>28</sup>は(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキルまたは(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキルで、好ましくはC<sub>1</sub> - ハロアルキルである。

【0053】

50

また、特に好ましいものは、記号およびインデックスが以下の意味をもつ式(II)の毒性緩和剤である：

Wは(W4)であり；

R<sup>17</sup>は水素、ハロゲン、ニトロ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)ハロアルキルで、好ましくはCF<sub>3</sub>または(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシであり；

n は1、2または3であり；

m は0または1であり；

R<sup>18</sup>は式OR<sup>24</sup>のラジカルであり；

R<sup>24</sup>は水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、カルボキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルで、好ましくは(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ-CO-CH<sub>2</sub>-、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ-CO-C(CH<sub>3</sub>)H-、HO-CO-CH<sub>2</sub>-またはHO-CO-C(CH<sub>3</sub>)H-であり；さらに

R<sup>29</sup>は水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)シクロアルキル、またはフェニルで、これは置換されていないか、またはハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキル、ニトロ、シアノおよび(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシから成る群から選ばれる1つまたは2つ以上のラジカルによって置換されている。

【0054】

以下の化合物群は、式(I)の除草活性をもつ物質のための毒性緩和剤として特に適当である：

a) ジクロロフェニルピラゾリン-3-カルボン酸型の化合物(すなわち式(II)の化合物で、式中、W = W1および(R<sup>17</sup>)<sub>n</sub> = 2, 4-C1<sub>2</sub>)、好ましくは以下のような化合物：エチル1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-(エトキシカルボニル)-5-メチル-2-ピラゾリン-3-カルボキシレート(II-1)およびWO-A-91/7874に記載されているような関連化合物；

【0055】

b) ジクロロフェニルピラゾールカルボン酸誘導体(すなわち式(II)の化合物で式中、W = (W2)および(R<sup>17</sup>)<sub>n</sub> = 2, 4-C1<sub>2</sub>)、好ましくは以下のような化合物：エチル1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-メチルピラゾール-3-カルボキシレート(II-2)、エチル1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-イソプロピルピラゾール-3-カルボキシレート(II-3)、エチル1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-(1, 1-ジメチルエチル)ピラゾール-3-カルボキシレート(II-4)、エチル1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-フェニルピラゾール-3-カルボキシレート(II-5)およびEP-A-0333131およびEP-A-0269806に記載されているような関連化合物；

【0056】

c) トリアゾールカルボン酸型化合物(すなわち式(II)の化合物で式中、W = (W3)および(R<sup>17</sup>)<sub>n</sub> = 2, 4-C1<sub>2</sub>)、好ましくはフェンクロラゾールのような化合物、すなわちエチル1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-トリクロロ-メチル-(1H)-1, 2, 4-トリアゾール-3-カルボキシレート(II-6)および関連化合物(EP-A-0174562およびEP-A-0346620参照)；

【0057】

d) 5-ベンジル-もしくは5-フェニル-2-イソキサゾリン-3-カルボン酸型または5, 5-ジフェニル-2-イソキサゾリン-3-カルボン酸型化合物(式中W = (W4))、好ましくは以下のような化合物：エチル5-(2, 4-ジクロロベンジル)-2-イソキサゾリン-3-カルボキシレート(II-7)またはエチル5-フェニル-2-イソキサゾリン-3-カルボキシレート(II-8)およびWO-A-91/8202に記載されているような関連化合物、またはエチル5, 5-ジフェニル-2-イソキサゾリンカルボキシレート型(II-9)、n-プロピル5, 5-ジフェニル-2-イソキサゾリンカルボキシレート型(II-10)またはエチル5-(4-フルオロフェニル)5-フェニル-2-イソキサゾリン-3-カルボキシレート型(II-11)(WO-A-95/7897に記載されているとおり)；

10

20

30

40

50

## 【 0 0 5 8 】

e) 8 - キノリンオキシ酢酸型化合物、例えば式(III)の化合物(式中、 $(R^{19})_n = 5 - C1$ 、水素、 $R^{20} = OR^{24}$ 、および $T = CH_2$ )で、好ましくは以下の化合物、  
 1 - メチルヘキシル(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)アセテート(III - 1、クロキントセット)、  
 1, 3 - ジメチルブタ - 1 - イル(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)アセテート(III - 2)、  
 4 - アリルオキシ - ブタ(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)アセテート(III - 3)、  
 1 - アリルオキシプロパ - 2 - イル(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)アセテート(III - 4)、  
 エチル(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)アセテート(III - 5)、  
 メチル(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)アセテート(III - 6)、  
 アリル(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)アセテート(III - 7)、  
 2 - (2 - プロピリデンイミノキシ) - 1 - エチル(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)アセテート(III - 8)、  
 2 - オキソプロパ - 1 - イル(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)アセテート(III - 9)、  
 およびEP - A - 0 860 750、EP - A - 0 094 349およびEP - A - 0 191 736あるいはEP - A - 0 492 366に記載されているような関連化合物。

10

## 【 0 0 5 9 】

f) (5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)マロン酸型の化合物、すなわち式(III)の化合物で式中、 $(R^{17})_n = 5 - C1$ 、 $R^{20} = OR^{24}$ 、 $T = -CH(COO - アルキル) -$ で、好ましくは以下の化合物、ジエチル(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)マロネート、ジアリル(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)マロネート、メチルエチル(5 - クロロ - 8 - キノリンオキシ)マロネート、およびEP - A - 582 198に記載されているような関連化合物。

20

## 【 0 0 6 0 】

g) ジクロロアセトアミド型、すなわち式(IV)の化合物、好ましくは以下のとおり：  
 N, N - ジアリル - 2, 2 - ジクロロアセトアミド(ジクロロミド、US - A - 4, 137, 070に開示)、  
 4 - ジクロロアセチル - 3, 4 - ジヒドロ - 3 - メチル - 2H - 1, 4 - ベンゾキサジン(ベノキサコール、EP 0 149 974に開示)、  
 N1, N2 - ジリル - N2 - ジクロロアセチルグリシンアミド(DKA - 24、HU 2143821に開示)、  
 4 - ジクロロアセチル - 1 - オキサ - 4 - アザ - スピロ〔4, 5〕デカン(AD - 67)、  
 2, 2 - ジクロロ - N - (1, 3 - ジオキソラン - 2 - イルメチル) - N - (2 - プロペニル)アセトアミド(PPG - 1292)、  
 3 - ジクロロアセチル - 2, 2, 5 - トリメチルオキサゾリジン、  
 3 - ジクロロアセチル - 2, 2 - ジメチル - 5 - フェニルオキサゾリジン、  
 3 - ジクロロアセチル - 2, 2 - ジメチル - 5 - (2 - チエニル)オキサゾリジン、  
 3 - ジクロロアセチル - 5 - (2 - フラニル) - 2, 2 - ジメチルオキサゾリジン(フリアゾール、MON 13900)、  
 1 - ジクロロアセチルヘキサヒドロ - 3, 3, 8a - トリメチルピロロ〔1, 2 - a〕ピリミジン - 6(2H) - オン(ジシクロノン、BAS 145138)、

30

40

## 【 0 0 6 1 】

h) 群B(b)の化合物、好ましくは以下のもの、  
 1, 8 - ナフタル酸無水物、  
 メチルジフェニルメトキシアセテート、  
 シアノメトキシイミノ(フェニル)アセトニトリル(シオメトリニル)、  
 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イルメトキシイミノ(フェニル)アセトニトリル(オキサベトリニル)、

50

4 - クロロ - 2, 2, 2 - トリフルオロアセトフェノン O - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イルメチルオキシム(フルキソフェニム)、  
 4, 6 - ジクロロ - 2 - フェニルピリミジン(フェンクロリム)、  
 ベンジル 2 - クロロ - 4 - トリフルオロメチル - 1, 3 - チアゾル - 5 - カルボキシレート(フルラゾール)、  
 2 - ジクロロメチル - 2 - メチル - 1, 3 - ジオキソラン(MG - 191)、  
 N - (4 - メチルフェニル) - N - (1 - メチル - 1 - フェニルエチル)尿素(ダイムロン)、  
 1 - [4 - (N - 2 - メトキシベンゾイルスルファモイル)フェニル] - 3 - メチル尿素、  
 1 - [4 - (N - 2 - メトキシベンゾイルスルファモイル)フェニル] - 3, 3 - ジメチル尿素、  
 1 - [4 - (N - 4, 5 - ジメチルベンゾイルスルファモイル)フェニル] - 3 - メチル尿素、  
 1 - [4 - (N - ナフトイルスルファモイル)フェニル] - 3, 3 - ジメチル尿素、  
 (2, 4 - ジクロロフェノキシ)酢酸(2, 4 D)、  
 (4 - クロロフェノキシ)酢酸、  
 (R, S) - 2 - (4 - クロロ - o - トリルオキシ)プロピオン酸(メコプロブ)、4 - (2, 4 - ジクロロフェノキシ)酪酸(2, 4 - DB)、  
 (4 - クロロ - o - トリルオキシ)酢酸(MCPA)、  
 4 - (4 - クロロ - o - トリルオキシ)酪酸、  
 4 - (4 - クロロフェノキシ)酪酸、  
 3, 6 - ジクロロ - 2 - メトキシ安息香酸(ジカムバ)、  
 1 - (エトキシカルボニル)エチル 3, 6 - ジクロロ - 2 - メトキシベンゾエート(ラクチジクロア)、  
 並びにそれらの塩およびエステル、好ましくは(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)。

## 【0062】

毒性緩和剤としてさらに好ましいものは、式(V)の化合物またはそれらの塩で、式中、R<sup>30</sup>は水素、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、フラニルまたはチエニルで、最後の4ラジカルの各々は置換されていなくてもよく、またはハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、および(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルチオから成る群から選ばれる1つまたは2つ以上の置換基によって置換されていてもよく、さらに環状ラジカルの場合には、さらに(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルおよび(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキルで置換されていてもよく；

R<sup>31</sup>は水素であり；

R<sup>32</sup>はハロゲン、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルスルホニルまたは(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルカルボニル、好ましくはハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキル(例えばトリフルオロメチル)、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシカルボニルまたは(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルスルホニルであり；

R<sup>33</sup>は水素であり；

R<sup>34</sup>は、ハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、フェニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、シアノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</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>4</sub>)アルコキシカルボニルまたは(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルカルボニル、好ましくはハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキル(例えばトリフルオロメチル)、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、または(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルチオであり；  
 nは0、1または2であり；さらに

mは1または2である。

## 【0063】

さらに好ましいものは式(VI)の毒性緩和剤で、式中、

10

20

30

40

50

$X^3$ はCHであり；

$R^{35}$ は水素、水素、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_2 - C_6)$ アルケニル、 $(C_5 - C_6)$ シクロアルケニル、フェニルまたは、窒素、酸素およびイオウから成る群から選ばれる3つまでの異種原子を有する3～6員の複素環で、最後の6つのラジカルは、ハロゲン、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_2)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_2)$ アルキルスルホニル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニルおよびフェニルから成る群から選ばれる1つまたは2つ以上の同一または異なる置換基によって場合によって置換されていてもよくさらに環状ラジカルの場合はさらに $(C_1 - C_4)$ アルキルおよび $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルで置換されていてもよく；

10

$R^{36}$ は水素、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_2 - C_6)$ アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ アルキニルで、最後の3つのラジカルは場合によって、ハロゲン、ヒドロキシル、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシおよび $(C_1 - C_4)$ アルキルチオから成る群から選ばれる同一または異なる1つもしくは2つ以上の置換基によって置換されていてもよく；

$R^{37}$ はハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、ニトロ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシカルボニルまたは $(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニルであり；

$R^{38}$ は水素であり；

$R^{39}$ はハロゲン、ニトロ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、フェニル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシカルボニルまたは $(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニルであり；

20

$n$ は0、1または2であり；さらに

$m$ は1または2である。

【0064】

式(VII)の毒性緩和剤の中でとりわけ好ましいものは以下のサブグループである：

-  $R^{48}$ および $R^{49}$ がH、 $(C_1 - C_8)$ アルキル、フェニル、フェニル $(C_1 - C_8)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ- $(C_1 - C_8)$ アルキル、 $(C_3 - C_6)$ アルケニルまたは $(C_3 - C_6)$ アルキニルである化合物で、フェニル環はF、Cl、Br、 $NO_2$ 、CN、 $OCH_3$ 、 $(C_1 - C_4)$ アルキルまたは $CH_3 - SO_2 -$ によって置換されていてもよい；

30

-  $R^a$ がHである化合物；

- Aが $R^b - Y^3$ である化合物；

- EがOである化合物；

-  $Q^1$ が $CR_2^{47}$ である化合物；

-  $R^{47}$ がHである化合物；

-  $m$  が1で、EがOまたはSである化合物；

-  $m = 0$ である化合物；

-  $R^{40}$ から $R^{44}$ までがHで、 $m$  が1で、EがOで、 $Q^1$ が $CR_2^{47}$ で、さらにAが $R^b - Y^3$ である化合物、特に、 $R^{47}$ がHで、 $R^b$ が $CH_3$ で、 $Y^3$ がOである化合物；

$Q^1$ が $CR_2^{47}$ で、 $m = 0$ である化合物、特に $R^{44}$ および $R^{47}$ がHで、Aが $R^b - Y^3$ であり、ここで $R^b$ は好ましくはメチルで、 $Y^3$ は好ましくはOである化合物。

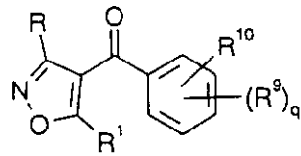
40

式(I)の除草剤の好ましい群は下記の表1から16に示す。

【0065】

【表1】

表 1 : (V = V1, Z = Z1)

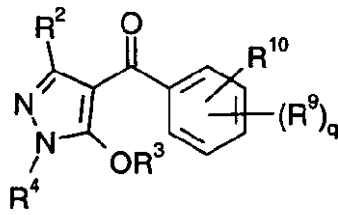


実施例	R	R1	(R9) <sub>q</sub>	R10
1-1	H	c-Pr	4-SEt	2-Bzl
1-2	H	c-Pr	4-SMe	2-Bzl
1-3	H	c-Pr	4-F-3-Me	2-(4-C1-Bzl)
1-4	H	c-Pr	4-SMe	2-(2-Me-Bzl)
1-5	H	c-Pr	4-SO <sub>2</sub> Me	2-(2-C1-Bzl)
1-6	H	c-Pr	4-SO <sub>2</sub> Me	2-(3-C1-Bzl)
1-7	H	c-Pr	4-SO <sub>2</sub> Me	2-(4-C1-Bzl)
1-8	H	c-Pr	4-SO <sub>2</sub> Me	2-(1-トリアゾリル)
1-9	COOEt	c-Pr	4-SO <sub>2</sub> Me	2-(1-トリアゾリル)
1-10	COOMe	c-Pr	4-SO <sub>2</sub> Me	2-(1-トリアゾリル)
1-11	H	c-Pr	4-SO <sub>2</sub> Me	2-(1-ピラゾリル)
1-12	COOEt	c-Pr	4-SO <sub>2</sub> Me	2-(1-ピラゾリル)
1-13	COOMe	c-Pr	4-SO <sub>2</sub> Me	2-(1-ピラゾリル)
1-14	H	c-Pr	4-SO <sub>2</sub> Me	2-(3,5-DiMe-1-ピラゾリル)
1-15	COOEt	c-Pr	4-SO <sub>2</sub> Me	2-(3,5-DiMe-1-ピラゾリル)
1-16	COOMe	c-Pr	4-SO <sub>2</sub> Me	2-(3,5-DiMe-1-ピラゾリル)
1-17	H	1-Me-c-Pr	4-SO <sub>2</sub> Me	2-(1-トリアゾリル)
1-18	COOEt	1-Me-c-Pr	4-SO <sub>2</sub> Me	2-(1-ピラゾリル)
1-19	COOMe	c-Pr	4-SO <sub>2</sub> Me	2-(3,5-DiMe-1-ピラゾリル)
1-20	H	c-Pr	2-C1-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(1-トリアゾリル)
1-21	COOEt	c-Pr	4-CF <sub>3</sub>	2-(CH <sub>2</sub> -1-トリアゾリル)
1-22	H	c-Pr	4-CF <sub>3</sub>	2-[CH <sub>2</sub> -PO(OEt) <sub>2</sub> ]
1-23	H	c-Pr	4-CF <sub>3</sub>	2-[CH <sub>2</sub> -PO(OMe) <sub>2</sub> ]
1-24	H	c-Pr	3-Br	2-[CH <sub>2</sub> -PO(OMe) <sub>2</sub> ]
1-25	COOEt	c-Pr	4-Br	2-[CH <sub>2</sub> -PO(OEt) <sub>2</sub> ]
1-26	COOEt	c-Pr	3,4-DiCl	2-[CH <sub>2</sub> -PO(OMe) <sub>2</sub> ]
1-27	COOEt	c-Pr	4-Br	2-[CH <sub>2</sub> -PO(OMe) <sub>2</sub> ]
1-28	COOEt	c-Pr	4-CF <sub>3</sub>	2-[CH <sub>2</sub> -PO(OMe) <sub>2</sub> ]
1-29	H	c-Pr	2-C1-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-チアゾリル)
1-30	COOEt	c-Pr	2-C1-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-チアゾリル)
1-31	H	1-Me-c-Pr	2-C1-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-チアゾリル)
1-32	COOEt	1-Me-c-Pr	2-C1-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-チアゾリル)
1-33	H	c-Pr	---	4-SF <sub>5</sub>

【 0 0 6 6 】

【 表 2 】

表 2 : (V = V2, Z = Z1)



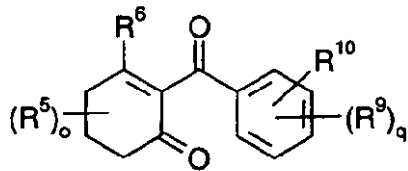
実施例	R2	R3	R4	(R9) <sub>q</sub>	R10
2-1	H	H	Me	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-チアゾリル)
2-2	Me	H	Me	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-チアゾリル)
2-3	H	SO <sub>2</sub> Me	Me	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-チアゾリル)
2-4	H	SO <sub>2</sub> -(4-Me-Ph)	Me	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-チアゾリル)

10

【 0 0 6 7 】

【 表 3 】

表 3 : (V = V3, Z = Z1)



実施例	(R5) <sub>o</sub>	R6	(R9) <sub>q</sub>	R10
3-1	-	OH	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-チアゾリル)
3-2	5-(CH(OMe) <sub>2</sub> )	OH	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-チアゾリル)
3-3	-	OH	4-Cl-2-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-チアゾリル)
3-4	5-(CH(OMe) <sub>2</sub> )	OH	4-Cl-2-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-チアゾリル)
3-5	5,5-DiMe	OH	2-Me-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-フラニル)
3-6	5,5-DiMe	OH	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-フラニル)
3-7	-	OH	2-Me-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-フラニル)
3-8	-	OH	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-フラニル)
3-9	-	OH	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	3-CH <sub>2</sub> OMe
3-10	-	OH	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	3-[CH <sub>2</sub> -CH(OMe) <sub>2</sub> ]
3-11	-	OH	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	3-O-C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OMe
3-12	-	OH	2,4-DiCl	3-O-CH <sub>2</sub> -(1,3-ジオキソラン-4-イル)
3-13	-	OH	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-イソキサゾリン-3-イル)
3-14	-	OH	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(1-ピラゾリルメチル)
3-15	-	OH	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	3-モルホリニル)

30

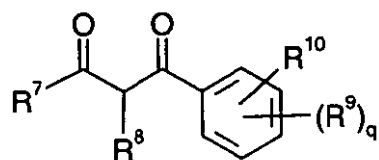
40

【 0 0 6 8 】

【 表 4 】



表 4 : (V = V4, Z = Z1)



実施例	R7	R8	(R9) <sub>q</sub>	R10
4-1	c-Pr	CN	4-S-Et	2-Bzl
4-2	c-Pr	CN	4-S-Me	2-Bzl
4-3	c-Pr	CN	4-F-3-Me	2-(4-Cl-Bzl)
4-4	c-Pr	CN	4-S-Me	2-(2-Me-Bzl)
4-5	c-Pr	CN	4-SO <sub>2</sub> Me	2-(2-Cl-Bzl)
4-6	c-Pr	CN	4-SO <sub>2</sub> Me	2-(3-Cl-Bzl)
4-7	c-Pr	CN	4-SO <sub>2</sub> Me	2-(4-Cl-Bzl)
4-8	c-Pr	CN	4-Br	2-(1-ピラゾリル)
4-9	c-Pr	CN	3,4-DiCl	2-(CH <sub>2</sub> -1-トリアゾリル)
4-10	c-Pr	CN	4-Br	2-[CH <sub>2</sub> PO(OEt) <sub>2</sub> ]
4-11	c-Pr	CN	4-Br	2-[CH <sub>2</sub> PO(OMe) <sub>2</sub> ]
4-12	c-Pr	CN	-	2-[CH <sub>2</sub> PO(OEt) <sub>2</sub> ]
4-13	c-Pr	CN	-	2-[CH <sub>2</sub> PO(OMe) <sub>2</sub> ]
4-14	c-Pr	CN	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-チアゾリル)
4-15	1-Me-c-Pr	CN	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-チアゾリル)
4-16	t-Bu	CN	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> Me	3-(2-チアゾリル)

10

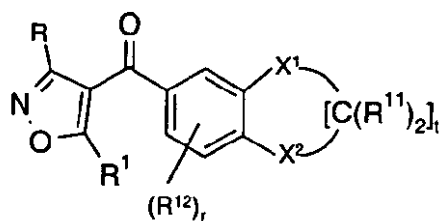
20

30

【 0 0 6 9 】

【 表 5 】

表 5 : (V=V1, Z=Z2)



実施例	R	R1	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	[C(R11) <sub>2</sub> ] <sub>t</sub>	(R12) <sub>r</sub>
5-1	H	c-Pr	C(OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O)	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
5-2	H	c-Pr	CHOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2-Me-5-Cl
5-3	H	c-Pr	O	O	CF <sub>2</sub>	2-[CH <sub>2</sub> PO(OMe) <sub>2</sub> ]
5-4	COOEt	c-Pr	O	O	CF <sub>2</sub>	2-[CHCH <sub>3</sub> PO(OEt) <sub>2</sub> ]
5-5	COOEt	1-Me-c-Pr	O	O	CF <sub>2</sub>	2-[CH <sub>2</sub> PO(OMe) <sub>2</sub> ]
5-6	COOEt	c-Pr	O	O	CF <sub>2</sub>	2-[CHCH <sub>3</sub> PO(OMe) <sub>2</sub> ]
5-7	H	c-Pr	C(SC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> S)	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
5-8	H	c-Pr	C(SC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> S)	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2-Me-5-Cl
5-9	H	c-Pr	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
5-10	H	c-Pr	CHOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
5-11	H	c-Pr	CHOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> F	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
5-12	H	c-Pr	C=NOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
5-13	H	c-Pr	C=NOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2-Me
5-14	H	c-Pr	C=NOMe	S	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe

10

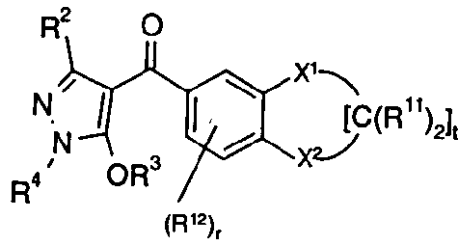
20

【 0 0 7 0 】

【 表 6 】

30

表 6 : (V=V2, Z=Z2)



実施例	R2	R3	R4	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	[C(R <sup>11</sup> ) <sub>2</sub> ] <sub>t</sub>	(R <sup>12</sup> ) <sub>r</sub>
6-1	H	H	Et	C(OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O)	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
6-2	H	H	Et	CHOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2-Me-5-Cl
6-3	H	H	Me	C(OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O)	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
6-4	H	H	Me	CHOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2-Me-5-Cl
6-5	H	H	Et	CO	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
6-6	H	H	Et	CO	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2-Me-5-Cl
6-7	H	SO <sub>2</sub> Me	Et	C(OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O)	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
6-8	H	SO <sub>2</sub> Me	Et	CHOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2-Me-5-Cl
6-9	H	SO <sub>2</sub> Me	Me	C(OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O)	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
6-10	H	SO <sub>2</sub> Me	Me	CHOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2-Me-5-Cl
6-11	H	SO <sub>2</sub> Me	Et	CO	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
6-12	H	SO <sub>2</sub> Me	Et	CO	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2-Me-5-Cl
6-13	Me	SO <sub>2</sub> -(4-Me-Ph)	Me	C=NOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
6-14	Me	CH <sub>2</sub> -CO-Ph	Me	C=NOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe

【 0 0 7 1 】

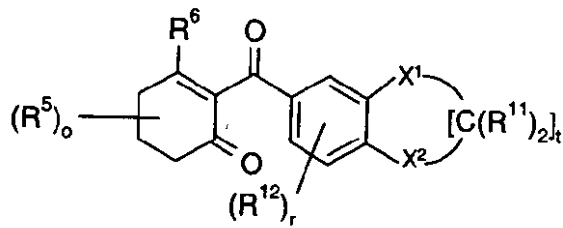
【 表 7 】

10

20

30

表 7 : (V=V3, Z=Z2)



実施例	R5	R6	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	[C(R11) <sub>2</sub> ] <sub>t</sub>	(R12) <sub>r</sub>
7-1	-	OH	C(OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O)	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
7-2	-	OH	CHOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2-Me-5-Cl
7-3	4,4-DiMe	OH	C(OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O)	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
7-4	4,4-DiMe	OH	CHOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2-Me-5-Cl
7-5	-	OH	C(OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O)	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	-
7-6	-	OH	CHOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	-
7-7	-	OH	CO	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
7-8	-	OH	CO	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2-Me-5-Cl
7-9	-	OH	C(OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O)	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiCl
7-10	-	OH	C(SC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> S)	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
7-11	5-(CH(OMe) <sub>2</sub> )	OH	C(OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O)	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
7-12	5-(CH(OMe) <sub>2</sub> )	OH	CHOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
7-13	-	OH	C=NOH	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	-
7-14	-	OH	CHOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe

10

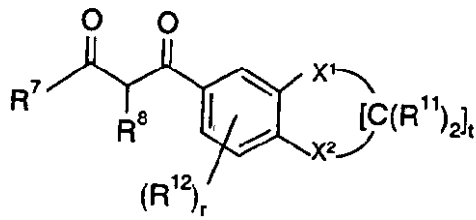
20

【 0 0 7 2 】

【 表 8 】

30

表 8 : (V = V4, Z = Z2)



実施例	R7	R8	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	[C(R <sup>11</sup> ) <sub>2</sub> ] <sub>t</sub>	(R <sup>12</sup> ) <sub>r</sub>
8-1	c-Pr	CN	C(OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O)	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
8-2	c-Pr	CN	CHOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2-Me-5-Cl
8-3	1-Me-c-Pr	CN	C(OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O)	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
8-4	1-Me-c-Pr	CN	CHOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2-Me-5-Cl
8-5	c-Pr	CN	C(SC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> S)	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
8-6	c-Pr	CN	C(SC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> S)	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2-Me-5-Cl
8-7	c-Pr	CN	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
8-8	c-Pr	CN	CHOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
8-9	c-Pr	CN	CHOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> F	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
8-10	c-Pr	CN	C=NOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe
8-11	c-Pr	CN	C=NOMe	SO <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2-Me
8-12	c-Pr	CN	C=NOMe	S	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub>	2,5-DiMe

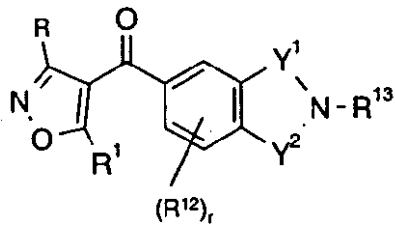
10

20

【 0 0 7 3 】

【 表 9 】

表 9 : (V = V1, Z = Z3)



実施例	R	R1	Y1	Y2	(R12) <sub>r</sub>	R13
9-1	H	c-Pr	SO <sub>2</sub>	CO	-	Me
9-2	H	c-Pr	SO <sub>2</sub>	CO	-	H
9-3	COOEt	c-Pr	SO <sub>2</sub>	CO	-	Me
9-4	COOEt	c-Pr	SO <sub>2</sub>	CO	-	H
9-5	H	1-Me-c-Pr	SO <sub>2</sub>	CO	-	Me
9-6	H	1-Me-c-Pr	SO <sub>2</sub>	CO	-	H
9-7	COOEt	1-Me-c-Pr	SO <sub>2</sub>	CO	-	Me
9-8	COOEt	1-Me-c-Pr	SO <sub>2</sub>	CO	-	H
9-9	H	1-SMe-c-Pr	SO <sub>2</sub>	CO	-	Me
9-10	H	1-SMe-c-Pr	SO <sub>2</sub>	CO	-	H
9-11	COOEt	1-SMe-c-Pr	SO <sub>2</sub>	CO	-	Me
9-12	COOEt	1-SMe-c-Pr	SO <sub>2</sub>	CO	-	H
9-13	H	c-Pr	CO	SO <sub>2</sub>	-	Me
9-14	COOEt	c-Pr	CO	SO <sub>2</sub>	-	Me
9-15	H	1-Me-c-Pr	CO	SO <sub>2</sub>	-	Me
9-16	COOEt	1-Me-c-Pr	CO	SO <sub>2</sub>	-	Me
9-17	H	1-SMe-c-Pr	CO	SO <sub>2</sub>	-	Me
9-18	COOEt	1-SMe-c-Pr	CO	SO <sub>2</sub>	-	Me

10

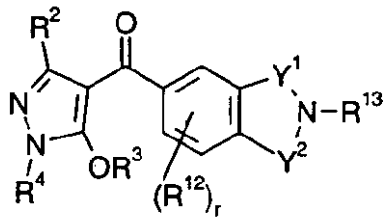
20

30

【 0 0 7 4 】

【 表 1 0 】

表 10 : (V = V2, Z = Z3)



実施例	R2	R3	R4	Y1	Y2	(R12) <sub>r</sub>	R13
10-1	H	H	Et	SO <sub>2</sub>	CO	-	Me
10-2	H	H	Et	SO <sub>2</sub>	CO	-	H
10-3	Me	H	Et	SO <sub>2</sub>	CO	-	Me
10-4	Me	H	Et	SO <sub>2</sub>	CO	-	H
10-5	H	H	Me	SO <sub>2</sub>	CO	-	Me
10-6	H	H	Me	SO <sub>2</sub>	CO	-	H
10-7	Me	H	Me	SO <sub>2</sub>	CO	-	Me
10-8	Me	H	Me	SO <sub>2</sub>	CO	-	H
10-9	H	H	Me	CO	SO <sub>2</sub>	-	Me
10-10	H	H	Me	CO	SO <sub>2</sub>	-	H
10-11	Me	H	Me	CO	SO <sub>2</sub>	-	Me
10-12	Me	H	Me	CO	SO <sub>2</sub>	-	H
10-13	Me	H	Me	CO	SO <sub>2</sub>	2-Me	Me

10

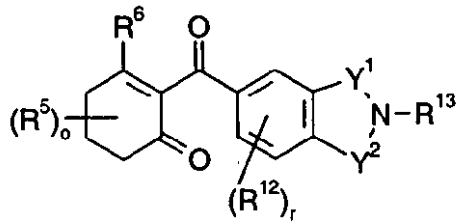
20

【 0 0 7 5 】

【 表 1 1 】

30

表 11 : (V=V3, Z=Z3)



実施例	(R5) <sub>o</sub>	R6	Y1	Y2	(R12) <sub>r</sub>	R13
11-1	-	OH	SO <sub>2</sub>	CO	-	Me
11-2	-	OH	SO <sub>2</sub>	CO	-	H
11-3	4,4-DiMe	OH	SO <sub>2</sub>	CO	-	Me
11-4	4,4-DiMe	OH	SO <sub>2</sub>	CO	-	H
11-5	-	OH	CO	SO <sub>2</sub>	-	Me
11-6	-	OH	CO	SO <sub>2</sub>	-	H
11-7	4,4-DiMe	OH	CO	SO <sub>2</sub>	-	Me
11-8	4,4-DiMe	OH	CO	SO <sub>2</sub>	-	H

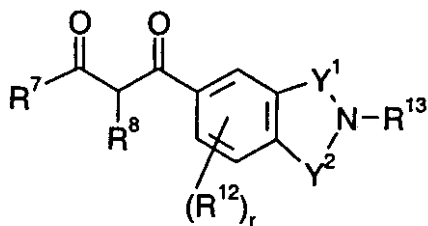
10

20

【 0 0 7 6 】

【 表 1 2 】

表 12 : (V=V4, Z=Z3)



実施例	R7	R8	Y1	Y2	(R12) <sub>r</sub>	R13
12-1	c-Pr	CN	SO <sub>2</sub>	CO	-	Me
12-2	c-Pr	CN	SO <sub>2</sub>	CO	-	H
12-3	1-Me-c-Pr	CN	SO <sub>2</sub>	CO	-	Me
12-4	1-Me-c-Pr	CN	SO <sub>2</sub>	CO	-	H
12-5	c-Pr	CN	CO	SO <sub>2</sub>	-	Me
12-6	c-Pr	CN	CO	SO <sub>2</sub>	-	H
12-7	1-Me-c-Pr	CN	CO	SO <sub>2</sub>	-	Me
12-8	1-Me-c-Pr	CN	CO	SO <sub>2</sub>	-	H

30

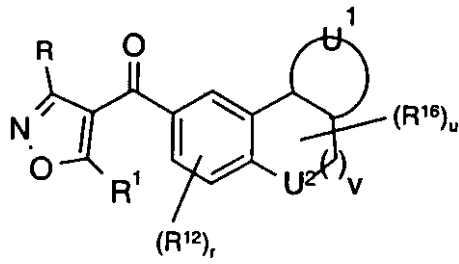
40

【 0 0 7 7 】

【 表 1 3 】



表 13 : (V=V1, Z=Z4)



実施例	R	R <sup>1</sup>	v	U <sup>2</sup>	(R <sup>12</sup> ) <sub>r</sub>	U <sup>1</sup>	(R <sup>16</sup> ) <sub>n</sub>
13-1	H	c-Pr	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
13-2	H	c-Pr	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
13-3	H	c-Pr	2	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
13-4	H	c-Pr	2	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
13-5	H	1-Me-c-Pr	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
13-6	H	1-Me-c-Pr	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-

10

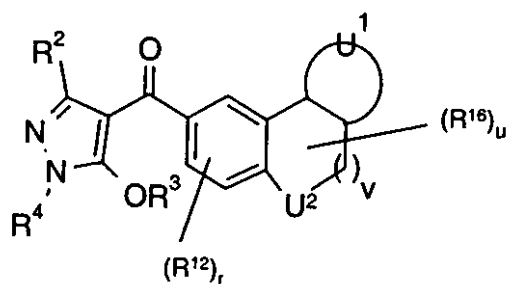
20

30

【 0 0 7 8 】

【 表 1 4 】

表 14 : (V = V2, Z = Z4)



実施例	R2	R3	R4	v	U <sup>2</sup>	(R <sup>12</sup> ) <sub>r</sub>	U <sup>1</sup>	(R <sup>16</sup> ) <sub>n</sub>
14-1	H	H	Et	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
14-2	H	H	Et	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
14-3	H	SO <sub>2</sub> -(4-Me)Ph	Et	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
14-4	H	SO <sub>2</sub> Me	Et	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
14-5	H	H	Et	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
14-6	H	H	Et	2	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
14-7	H	H	Et	2	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
14-8	H	H	Me	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
14-9	H	H	Me	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-

【 0 0 7 9 】

【 表 1 5 】

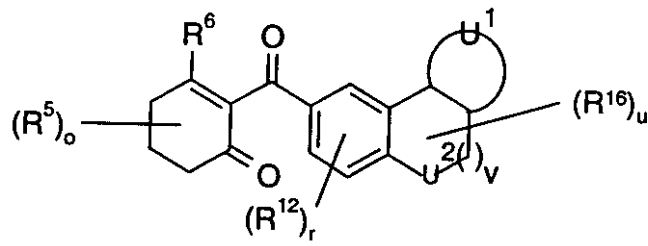
10

20

30

40

表 15 : (V=V3, Z=Z4)



実施例	(R <sup>5</sup> ) <sub>o</sub>	R <sup>6</sup>	V	U <sup>2</sup>	(R <sup>12</sup> ) <sub>r</sub>	U <sup>1</sup>	(R <sup>16</sup> ) <sub>n</sub>
15-1	-	OH	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
15-2	-	OH	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
15-3	-	OH	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
15-4	5-Me	OH	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
15-5	5-Me	OH	2	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
15-6	-	OH	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
15-7	-	OH	2	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-

【 0 0 8 0 】

【 表 1 6 】

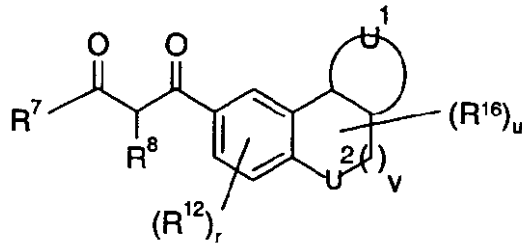
10

20

30

40

表 16 : (V=V4, Z=Z4)



実施例	R7	R8	V	U <sup>2</sup>	(R <sup>12</sup> ) <sub>r</sub>	U <sup>1</sup>	(R <sup>16</sup> ) <sub>n</sub>
16-1	c-Pr	CN	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
16-2	1-Me-c-Pr	CN	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
16-3	c-Pr	CN	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-
16-4	1-Me-c-Pr	CN	1	SO <sub>2</sub>	2,5-DiMe		-

## 【 0 0 8 1 】

式(II) - (VII)の毒性緩和剤(解毒剤)および群(b)の化合物、例えば上記の群a) - h)の毒性緩和剤は、式(I)の除草活性を有する物質を有用な作物に用いた場合発生する可能性がある植物毒性作用を、これら除草活性を有する物質の有害な植物に対する作用に実質的に影響を与えることなく低下させるかまたは防止する。これによって、通常の作物保護生成物の適用分野が顕著に拡大され、前記除草剤の使用がこれまで不可能または限定されていた、すなわち低い割合および限定範囲で使用されていた、例えばコムギ、オオムギ、トウモロコシおよび他の作物にまで拡大することが可能になる。

## 【 0 0 8 2 】

除草活性物質および前述の毒性緩和剤は、(レディミックスとしてまたはタンク混合の方法によって)一緒に用いるか、または所望する任意の順序で連続的に用いることができる。毒性緩和剤：除草活性物質の重量比は広い限定範囲の中で変動可能で、好ましくは1：100から100：1、特に1：10から10：1の範囲にある。各事例で用いられる除草活性物質と毒性緩和剤の最適な量は、使用される除草活性物質の種類または使用される毒性緩和剤に応じて、さらに処置されるべき成長中の作物の種によって左右され、単純な日常的予備実験によって個々の事例で判定することができる。

## 【 0 0 8 3 】

本発明の配合物の主要な適用分野は、特にトウモロコシおよび穀類作物(例えばコムギ、ライムギ、オオムギ、エンパク、コメ、モロコシ)、さらにまた綿花およびダイズで、好ましくは穀類、コメおよびトウモロコシである。それらの特性により本発明にしたがって用いられる毒性緩和剤は、作物の種子を予備処理するために用いるか(シードドレッシング)、または種蒔きの前に種子の畝に混ぜるかもしくは植物の発芽の前後に除草剤と一緒に用いてもよい。発芽前処理には、播種前の耕作領域の処置だけでなく、種子が蒔かれているがまだ植物が出現していない耕作領域の処置が

10

20

30

40

50

含まれる。除草剤と一緒に用いる混合適用が好ましい。この目的のために、タンク混合物またはレディミックスを用いることができる。

【0084】

必要な毒性緩和剤の適用比は広い限定範囲内で、指示および使用される除草活性物質にしたがって変動させることができ、一般に1ヘクタールにつき0.001から5kg、好ましくは0.005から0.5kgの範囲の活性物質である。

したがって、本発明はまた式(I)の除草剤の植物毒性副作用から作物を保護する方法に関する。本方法は、式(II)、(III)、(IV)、(V)、(VI)、(VII)の化合物および/または群(b)から選ばれた化合物の解毒有効量を植物、植物の種子または耕作領域に、式(I)の除草活性物質Aの適用前、後または同時に使用することを含む。

10

【0085】

本発明の除草剤/毒性緩和剤配合物はまた、既に知られているか、または今後開発される遺伝子工学処理作物において有害な植物を制御するために用いることができる。一般的に、遺伝子導入植物は、特定の有利な特性、例えばある種の作物保護薬剤に対する耐性、植物の病気に対する耐性、または植物の病気を引き起こす植物病原体(特に昆虫または微生物(例えば真菌、細菌またはウイルス))に対する耐性によって区別される。他の具体的な特性は、例えば量、品質、保存特性、組成および固有の成分において収穫物に関するものである。したがって、澱粉含有量が増加した遺伝子導入植物または澱粉の品質が改変された遺伝子導入植物が存在し、または収穫物で異なる脂肪酸組成を有する遺伝子導入植物が知られている。

20

【0086】

本発明の配合物は、有用な植物および鑑賞植物で経済的に重要な遺伝子導入作物、例えば穀類、例えばコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク、モロコシ、アワ、コメ、キャッサバおよびトウモロコシまたは他の作物、サトウダイコン、綿花、ダイズ、ナタネ、ジャガイモ、トマト、エンドウおよび他の野菜で使用される。

本発明の配合物を遺伝子導入作物に用いる場合、他の作物で観察されるべき有害な植物に対する作用は、対象の遺伝子導入作物に適用した場合にはしばしば特異的な作用によって達成される。そのような作用は、例えば制御可能な雑草の範囲の改変または特異的な拡大、使用可能な適用比の改変、遺伝子導入作物が耐性を示す除草剤との極めて良好な適合、および遺伝子導入作物の成長および収量の改変である。

30

本発明はしたがってまた本発明の配合物を遺伝子導入植物において有害な植物を制御するために使用することに関する。

【0087】

式(III)-(VII)および群(b)の毒性緩和剤と上記の式(II)の除草活性物質の1つまたは2つ以上との配合物は、具体的な生物学的および/または物理化学的パラメーターにしたがって多様な方法で製剤化できる。

適当であると考えられる製剤の例は以下のとおりである：

湿潤可能粉末(WP)、乳化可能濃縮物(EC)、水溶性粉末(SP)、水溶性濃縮物(SL)、濃縮乳液(BW)(例えば水中油および油中水乳液)、噴霧可能溶液または乳液、カプセル分散物(CS)、油性または水性基剤分散液(SC)、分散乳液、分散濃縮物、ダスト(DP)、油混合性溶液(OL)、種子処理用生成物、以下の形態の顆粒(GR)；微粒子顆粒、噴霧用顆粒、被覆顆粒および吸収用顆粒、土壌適用または散布用顆粒、水溶性顆粒(SG)、水に分散性の顆粒(WG)、UVL製剤、マイクロカプセルおよびワックス。

40

【0088】

これら個々の製剤のタイプは本質的には既知で、例えば以下の文献に記載されている：Winnacker-Kuechler, "Chemische Technologie"(ChemicalTechnology), Vol.7, C. Hauser Verlag Munich, 4th Edition 1986; Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying Handbrook", 3rd Edition 1979, G. Goodwin Ltd. London.

【0089】

50

必要な製剤補助剤、例えば不活性物質、界面活性剤、溶媒および他の添加物もまた知られており、例えば以下の文献に記載されている：Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide"; 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schoenfeldt, "Grenzflaechenaktive Aethylenoxidaddukte"(Surface-Active Ethylene Oxide Adducts), Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Kuechler, "Chemische Technologie"(Chemical Technology), Vol.7, C. Hauser Verlag Munich, 4th Edition 1986.

10

## 【 0 0 9 0 】

これらの製剤を主剤として、作物保護剤として作用する他の物質、例えば殺昆虫剤、殺ダニ剤、除草剤、殺真菌剤と、さらに毒性緩和剤、肥料および/または成長調節剤との配合物を、例えばレディミックスマたはタンク混合物として製造することが可能である。

湿潤可能粉末は、水の中で均一に分散できる調製物で、活性物質の他にイオン性および/または非イオン性界面活性剤(湿潤剤、分散剤)、例えばポリオキシエチル化アルキルフェノール、ポリオキシエチル化脂肪アルコール、ポリオキシエチル化脂肪アミン、脂肪アルコールポリグリコールエーテルスルフェート、アルカンスルホネート、アルキルベンゼンスルホネート、ナトリウムリグノスルホネート、ナトリウム 2, 2 - ジナフチルメタン - 6, 6 - ジスルホネート、ナトリウムジブチルナフタレンスルホネート、または他のナトリウムオレオイルメチルタウリネートを希釈剤または不活性物質の他に含んでいる。湿潤可能粉末を製造するためには、除草活性物質を、例えばハンマーミル、送風式ミルおよびエアージェットミルのような通常の装置で細かくすりつぶし、さらに同時にまたは連続して製剤補助剤と混合する。

20

## 【 0 0 9 1 】

乳化可能濃縮物は、例えば、1つまたは2つ以上のイオン性および/または非イオン性界面活性剤(乳化剤)を添加しながら、有機溶媒(例えばブタノール、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド)また他には、高沸点炭化水素(例えば飽和または不飽和脂肪族炭化水素もしくは脂環式炭化水素)、芳香族または有機溶媒の混合物中に活性物質を溶解させることによって製造される。乳化剤として用いることができる物質の例は、カルシウムアルキルアリアルスルホネート(例えばカルシウムドデシルベンゼンスルホネート)または非イオン性乳化剤(例えば脂肪酸ポリグリコールエステル、アルキルアリアルポリグリコールエーテル、脂肪酸アルコールポリグリコールエーテル、プロピレンオキシド/エチレンオキシド縮合物、アルキルポリエーテル、ソルピタンエステル、例えば、ソルピタン脂肪酸エステルまたはポリオキシエチレンソルピタンエステル、例えばポリオキシエチレンソルピタン脂肪酸エステルである。

30

## 【 0 0 9 2 】

ダストは一般に、細かく分散させた固形物質、例えばタルク、天然粘土、例えばカオリン、ベントナイトおよびパイロフィライトまたは珪藻土とともに活性物質をすりつぶすことによって得られる。

40

分散濃縮物は水または油を主剤とすることができる。それらは、例えば市販のピーズミルを用い、界面活性剤の存在下または非存在下で湿潤研磨を実施することによって製造できる。界面活性剤は、例えば他の製剤タイプの場合について上記で既に述べたものである。

## 【 0 0 9 3 】

乳化物(例えば油中水乳液(EW))は、例えば界面活性剤(例えば他の製剤タイプの場合について上記で既に述べたもの)の存在下または非存在下で水性有機溶媒を用いて攪拌装置、コロイドミルおよび/または固定ミキサーによって製造できる。

顆粒は、活性物質を粘着性顆粒化不活性物質に噴霧するか、または活性物質濃縮物を担体(例えば砂、カオリンまたは顆粒化不活性物質)表面に結合剤(例えばポリビニルアルコー

50

ル、ナトリウムポリアクリレートまたはその外には鉱物油)とともに散布することによって製造できる。適当な活性物質はまた、肥料顆粒の製造で一般的な態様で、所望の場合は肥料との混合物として顆粒化できる。一般的には、水分散性顆粒は、一般的な方法(例えば噴霧乾燥、流動床顆粒化、ディスク顆粒化)により、高速ミキサーで混合し、固形不活性物質の非存在下で押し出しながら製造できる。

【0094】

ディスク型流動床押し出し噴霧式顆粒の製造の場合は、例えば以下の方法を参照されたい：  
：“Spray-Drying Handbook”，3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J.E. Browning, “Agglomeration”, Chemical and Engineering 1967, pages 147 et seq.; “Perry's Chemical Engineer's Handbook”, 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, p.8-57.

作物保護生成物の製剤化についてのいっそうの詳細については、例えば以下の文献を参照されたい：  
：“Weed Control as a Science”, John Wiley & Sons, Inc., New York, 1961, pages 81-96; J.D. Freyer, S.A. Evans, “Weed Control Handbook”, 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, pages 101-103.

【0095】

一般的に、農業用化学調製物は、式(II) - (VII)および/または(b)の活性物質、または活性物質(I)および(II) - (VII)および/または(b)の除草剤/解毒剤混合物の重量で0.1 ~ 99%、特に重量で0.1 ~ 95%、並びに固形または液体添加物の重量で1 ~ 99.9%、特に重量で5 ~ 99.8%、並びに界面活性剤の重量で0 ~ 25%、特に重量で0.1 ~ 25%を含む。

【0096】

湿潤可能粉末の場合には、活性物質の濃度は、例えば重量で約10 ~ 90%で、重量で100%にするための残余物は一般的な製剤成分で構成される。乳化可能濃縮物の場合には、活性物質の濃度は例えば重量で約1 ~ 80%である。ダスト形製剤は重量で1 ~ 20%の活性物質を含み、噴霧可能溶液は重量で約0.2 ~ 20%の活性物質を含む。顆粒(例えば水分散性顆粒)の場合には、活性物質の含有量は、部分的には活性化化合物が液体中に含まれるかまたは固体形であるかによって左右される。水に分散性の顆粒の活性物質含有量は、例えば重量で10 ~ 90%の間である。

これの他に、上記の活性物質製剤は、適当な場合には、各事例で一般的な粘着剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、浸透剤、保存料、抗凍結剤、溶媒、充填剤、担体、着色剤、泡立ち防止剤、蒸発抑制剤並びにpHおよび粘性調節物質を含む。

【0097】

混合製剤またはタンクミックスとしての本発明の除草剤/毒性緩和剤混合物と一緒に用いることができる成分は、例えば以下の文献に記載されている既知の活性物質である：  
Weed Research 26, 441-445(1986)；または“The Pesticide Manual”, 10th Ed., The British Crop Protection Council, (1994)、およびそれらに引用されている文献。文献に記載されている除草剤として例示できる、本発明の混合物と併用できる活性物質の例は以下のとおりである(注記：ISO(International Organization for Standardization)による化合物の一般名または化学名が、適当な場合には一般的コード番号と一緒に表示されている)：

【0098】

アセトクロア；アシフルオルフェン；アクロニフェン；AKH7088、すなわち〔〔〔1 - 〔5 - 〔2 - クロロ - 4 - (トリフルオロメチル)フェノキシ〕 - 2 - ニトロフェニル〕 - 2 - メトキシエチリデン〕アミノ〕オキシ〕 - 酢酸およびそのメチルエステル；アラクロア；アロキシジム；アメトリン；アミドスルフロソ；アミトロール；AMS、すなわちアンモニウムスルファメート；アニロフォス；アスラム；アトラジン；アザフェニジン(DPX - R6447)、アジムスルフロソ(DPX - A8947)；アジプロトリン；バルバン；BAS516H、すなわち5 - フルオロ - 2 - フェニル - 4H - 3,1 - ベンゾキサジン - 4 - オン；ペナゾリン；ベンフルラリン；ベンフレセート；ベンスルフロソ - メチル；ベンスリド；ベントゾン；ベンゾフルオア；ベンゾイルプロパ - エチル；ベンズチ

アズロン；ピアラフォス；ピフェノクス；ビスピリバク - ナトリウム(K I H - 2 0 2 3)、プロマシル；プロモブチド；プロモフェノキシム；プロモキシニル；プロムロン；プミナフォス；プソキシノン；プタクロア；プタミフォス；プテナクロア；プチダゾル；プトラリン；プトロキシジム(I C I - 0 5 0 0)、プチレート；カフェンストロール(C H - 9 0 0)；カルベタミド；カフエントラゾン；C D A A、すなわち 2 - クロロ - N, N - ジ - 2 - プロペニルアセトアミド；C D E C、すなわち 2 - クロロアリルジエチルジチオカルバメート；クロメトキシフェン；クロラムベン；クロランスラム - メチル(X D E - 5 6 5)、クロラジフォブ - ブチル、クロルプロムロン；クロルブファミ；クロルフェナック；クロルフルレコル - メチル；クロリダゾン；クロリムロンエチル；クロルニトロフェン；クロロトルロン；クロロクスロン；クロルプロファミ；クロルスルフロソ；クロルサル - ジメチル；クロルチアミド；シニドン - エチル；シンメチリン；シノスルフロソ；クレフォキシジム；クレトジム；クロジナフォブおよびそのエステル誘導体(例えばクロジナフォブ - プロパルギル)；クロマゾン；クロメプロブ；クロプロキシジム；クロピラリド；クミルロン(J C 9 4 0)；シアナジン；シクロエート；シクロスルファミロン(A C 0 1 4)；シクロキシジム；シクルロン；シハロフォブおよびそのエステル誘導体(例えばブチルエステル、D H E - 1 1 2)；シペルクォート；シプラジン；シプラゾル；2, 4 - D B；ダラボン；

## 【 0 0 9 9 】

デスメジファミ；デスメトリン；ジ - アレート；ジカムバ；ジクロベニル；ジクロアプロブおよびそのエステル、例えばジクロフォブ - メチル；ジクロスラム(X D E - 5 6 4)、ジエタチル；ジフェノクスロン；ジフェンゾクォート；ジフルフェニカン；ジフルフェンゾピル - ナトリウム(S A N - 8 3 5 H)、ジメフロソ；ジメタクロア；ジメタメトリン；ジメテナミド(S A N - 5 8 2 H)；ジメタゾン；5 - (4, 6 - ジメチルピリミジン - 2 - イル - カルバモイルスルファミモイル) - 1 - (2 - ピリジル) - ピラゾール - 4 - カルボキシレート、(N C - 3 3 0)；クロマゾン；ジメチピン；ジメトラスルフロソ、ジニトラミン；ジノセブ；ジノテルブ；ジフェナミド；ジプロペトリン；ジクォート；ジチオピル；ジウロン；D N O C；エグリナジン - エチル；E L 1 7 7、すなわち 5 - シアノ - 1 - (1, 1 - ジメチルエチル) - N - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボクスアミド；エンドタール；エポプロダン(M K - 2 4 3)、E P T C；エスプロカルブ；エタールフルラリン；エタメトスルフロソ - メチル；エチジムロン；エチオジン；エトフメセート；F 5 2 3 1、すなわち N - { 2 - クロロ - 4 - フルオロ - 5 - { 4 - (3 - フルオルプロピル) - 4, 5 - ジヒドロ - 5 - オキソ - 1 H - テトラゾル - 1 - イル } フェニル } エタンスルホンアミド；エトキシフェンおよびそのエステル(例えばエチルエステル、H N - 2 5 2)；エトキシスルフロソ(E P 3 4 2 5 6 9 で開示)エトベンザニド(H W 5 2)；3 - (4 - エトキシ - 6 - エチル - 1, 3, 5 - トリアジン - 2 - イル) - 1 - (2, 3 - ジヒドロ - 1, 1 - ジオキソ - 2 - メチルベンゾ [ b ] チオフェン - 7 - スルホニル)尿素(E P - A - 7 9 6 8 3)；3 - (4 - エチル - 6 - メトキシ - 1, 3, 5 - トリアジン - 2 - イル) - 1 - (2, 3 - ジヒドロ - 1, 1 - ジオキソ - 2 - メチルベンゾ [ b ] チオフェン - 7 - スルホニル)尿素(E P - A - 7 9 6 8 3)；フェノプロブ；フェノキサン、フェノキサプロブおよびフェノキサプロブ - P およびそれらのエステル、例えばフェノキサプロブ - P - エチルおよびフェノキサプロブ - エチル；フェノキシジム；フェントラズアミド(N B A - 0 6 1)；フェヌロン；フラムプロブ - メチル；フラザスルフロソ；フルフェナセト(B A Y - F O E - 5 0 4 3)、フルアジフォブおよびフルアジフォブ - P、フロラスラム(D E - 5 7 0)およびそれらのエステル、例えばフルアジフォブ - ブチルおよびフルアジフォブ - P - ブチル；フルアゾレート(M o n - 4 8 5 0 0)、フルクロラリン；フルカルバゾン - ナトリウム；フルメトスラム；フルメトウロン；フルミクロラクおよびそれらのエステル(例えばベンチルエステル、S - 2 3 0 3 1)；フルミオキサジン(S - 4 8 2)；フルミプロピン；フルボキサム(K N W - 7 3 9)；フルオロジフェン；

## 【 0 1 0 0 】

フルオログリコフェン - エチル；フルプロパシル(U B I C - 4 2 4 3)；フルピルスルフ

10

20

30

40

50



ロン - メチルナトリウム(D P X - K E 4 5 9)、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;フルチアセト - メチル(K I H - 9 2 0 1)、フオメサフェン;ホサミン;フリルオキシフェン;グルホシネート;グリフォセート;ハロサフェン;ハロスルフロンおよびそのエステル(例えばメチルエステル、N C - 3 1 9);ハロキシフォブおよびそのエステル;ハロキシフォブ - P (= R - ハロキシフォブ)およびそのエステル;ヘキサジノン;イマザメタベンズ - メチル;イマザモクス(A C - 2 9 9 2 6 3)、イマザピル;イマザキンおよび塩、例えばアンモニウム塩;イマゼタメタピル;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 - 4 - ヨード - 2 - [ 3 - ( 4 - メトキシ - 6 - メチル - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イル)ウレイドスルホニル] - ベンゾエート、ナトリウム塩、W O 9 2 / 1 3 8 4 5);イオキシニル;イソカルバミド;イソプロバリン;イソプロツロン;イソウロン;イソキサベン;イソキサピリフォブ;カルブチレート;ラクトフェン;レナシル;リヌロン;M C P A ; M C P B ; メコプロブ;メフェナセト;メフルイディッド;メタミトロン;メタザクロア;メタベンズチアズロン;メタム;メタゾール;メトキシフェノン;メチルダイムロン;メトベンズロン;メチル = 2 - [ 3 - ( 4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル)ウレイドスルホニル] - 4 - メタンスルホンアミドメチルベンゾエート(W O 9 5 / 1 0 5 0 7);メトベンズロン;メトプロムロン;メトラクロア;S - メトラクロア、メトスラム(X R D 5 1 1);メトキシウロン;メトリブジン;メトスルフロン - メチル;M H ; モリネート;モナリド;モノカルバミドジヒドロゲンスルフェート;モノリヌロン;モヌロン;M T 1 2 8、すなわち6 - クロロ - N - ( 3 - クロロ - 2 - プロペニル) - 5 - メチル - N - フェニル - 3 - ピラジダジンアミン;M T 5 9 5 0、すなわちN - [ 3 - クロロ - 4 - ( 1 - メチルエチル)フェニル] - 2 - メチルペンタンアミド;N, N - ジメチル - 2 - [ 3 - ( 4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル)ウレイドスルホニル] - 4 - フォルミルアミノベンズアミド(W O 9 5 / 1 3 4 4);ナプロアニリド;ナプロアミド;ナブタラム;N C 3 1 0、すなわち4 - ( 2 , 4 - ジクロロベンゾイル) - 1 - メチル - 5 - ベンジルオキシピラゾール;ネブロン;ニコスルフロン;ニピラクロフェン;ニトラリン;ニトロフェン;ニトロフルオルフェン;ノルフルラゾン;オルベンカルブ;オリザリン;オキサジアルギル(R P - 0 2 0 6 3 0);オキサジアゾン;オキサジクロメフォン(M Y - 1 0 0)、オキシフルオルフェン;オキサスルフロン(C G A - 2 7 7 4 7 6)、パラクオート;ペプレート;ベンジメタリン;ペントキサゾン(K P P - 3 1 4)、ペルフルイドン;フェニソファム;フェンメジファム;ピクロラム;ピペロフォス;ピリブチカルブ;ピリフェノブ - ブチル;プレチラクロア;プリミスルフロン - メチル;

## 【 0 1 0 1 】

プラカルバゾン - ナトリウム;プロシアジン;プロジアミン;プロフルラリン;プログリナジン - エチル;プロメトン;プロメトリン;プロパクロア;プロパニル;プロパキサフォブおよびそのエステル;プロパジン;プロファム;プロピソクロア;プロピザミド;プロスルファリン;プロスルフォカルブ;プロスルフロン(C G A - 1 5 2 0 0 5);プリナクロア;ピラフルフェン - エチル(E T - 7 5 1);ピラゾン;ピラゾスルフロン - エチル;ピラゾキシフェン;ピリベンゾキシム、ピリダフォル;ピリデート;ピリミノバク - メチル(K I H - 6 1 2 7)、ピリチオバク(K I H - 2 0 3 1);ピロキソフォブおよびそのエステル(例えばプロパギルエステル);キンクロラク;キンメラク;キノフォブおよびそのエステル誘導体、キサロフォブおよびキサロフォブ - P およびそれらのエステル誘導体、例えばキサロフォブ - エチル;キサロフォブ - P - テフリルおよび - エチル;レンリドゥロン;リムスルフロン(D P X - E 9 6 3 6);S 2 7 5、すなわち2 - [ 4 - クロロ - 2 - フルオロ - 5 - ( 2 - プロピニルオキシ)フェニル] - 4, 5, 6, 7 - テトラヒドロ - 2 H - インダゾール;セクブメトン;セトキシジム;シドゥロン;シマジン;シメトリン;S N 1 0 6 2 7 9、すなわち2 - [ [ 7 - [ 2 - クロロ - 4 - (トリフルオロメチル)フェノキシ] 2 - ナフタレニル] オキシ] - プロパン酸およびそのメチルエステル;スルフェントラゾン(F M C - 9 7 2 8 5、F - 6 2 8 5);スルファズロン;スルフォメツロン - メチル;スルフォセート(I C I - A 0 2 2 4);スルフォスルフロン(M O N - 3 7 5

10

20

30

40

50

00)、TCA;テブタム(GCP-5544);テブチウロン;テラルオキシジム(BAS-620H)、テルバシル;テルブカルブ;テルブクロア;テルブメトン;テルブチラジン;テルプトリン;TFH450、すなわちN,N-ジエチル-3-[(2-エチル-6-メチルフェニル)スルフォニル]-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド;テニルクロア(NSK-850);チアザフルロン;チアゾピル(Mon-13200);チジアジミン(SN-124085);チフェンスルフロ-メチル;チオベンカルブ;チオカルバジル;トラルコキシジム;トリ-アレート;トリアスルフロ-メチル;トリアジフラム(DH-1105);トリアゾフェンアミド;トリベヌロン-メチル;トリクロピル;トリジファン;トリエタジン;トリフルラリン;トリフルスルフロ-メチルおよびエステル(例えばメチルエステル、DPX-66037);トリメツロン;チトデフ;ベルノレート;WL110547、すなわち5-フェノキシ-1-[(3-(トリフルオロメチル)フェニル)-1H-テトラゾール];UBH-509;D-489;LS82-556;KPP-300;KPP-421、MT-146、NC-324;KH-218;DPX-N8189;DOWCO-535;DK-8910;V-53482;PP-600;MBH-001。

#### 【0102】

市販の形態を有する製剤を使用するためには、所望する場合は通常の態様、例えば湿潤可能粉末、乳化可能濃縮物、分散物および水に分散性の顆粒の場合は水を用いて希釈する。ダスト、土壌顆粒、散布用顆粒および噴霧可能溶液の形状を有する調製物は、通常は使用前に他の不活性物質でさらに希釈することはない。

式(I)の除草剤の必要な適用率は、外的条件、とりわけ温度、湿度および使用する除草剤の性質により変動する。適用率は広い範囲内、例えば0.001から10.0kg/haまたはそれ以上の活性成分範囲(好ましくは0.005から5kg/ha)で変動しうる。

#### 【0103】

##### 【実施例】

以下の実施例は本発明を詳述しようとするものである。

##### A. 製剤実施例

a) ダストは、重量で10部の式(II)-(VII)の化合物および/または(群(b)から)、または式(I)の除草活性物質と式(II)-(VII)の毒性緩和剤および/または群(b)からの物質との活性物質混合物を、不活性物質として重量で90部のタルクを混合し、さらにこの混合物をハンマーミルで粉末化することによって得ることができる。

#### 【0104】

b) 水に直ちに分散できる状態の湿潤可能粉末は、重量で25部の式(II)、(III)、(IV)および/または(B(b))の化合物、または式(I)の除草活性物質と式(II)、(III)、(IV)の毒性緩和剤および/または群B(b)の物質との活性物質混合物を、不活性物質として重量で64部のカオリン含有石英、湿潤剤および分散剤として重量で10部のカリウムリグノスルホネートおよび重量で1部のナトリウムオレオイルメチルタウリネートと混合し、さらにこの混合物を固定円盤ミルですりつぶして得ることができる。

#### 【0105】

c) 水に直ちに分散できる分散濃縮物は、重量で20部の式(II)-(VII)および/または群(b)の化合物、または式(I)の除草活性物質と式(II)-(VII)の毒性緩和剤および/または群(b)の物質との活性物質混合物を、重量で6部のアルキルフェノールポリグリコールエーテル(トリトンX207(登録商標))、重量で3部のイソトリデカノールポリグリコールエーテル(8EO)および重量で71部のパラフィン鉱物油(沸騰範囲は、例えば約255から277以上)と混合し、さらにこの混合物をボールミルで5ミクロン以下の細かさにすりつぶして得ることができる。

#### 【0106】

d) 乳化可能濃縮物は、重量で15部の式(II)-(VII)および/または群(b)の化合物、または式(I)の除草活性物質と式(II)-(VII)の毒性緩和剤および/または群(b)の物質との活性物質混合物、溶媒として重量で75部のシクロヘキサノン、および乳化剤として

重量で10部のエトキシ化ノニルフェノールから得ることができる。

【0107】

e) 水分散性顆粒は、

重量で75部の式(II) - (VII)および/または群(b)の化合物、または式(I)の除草活性物質と式(II) - (VII)の毒性緩和剤および/または群bの物質との活性物質混合物を、

重量で10部のカルシウムリグノスルホネート、

重量で5部のラウリル硫酸ナトリウム、

重量で3部のポリビニルアルコール、および

重量で7部のカオリンと混合し、さらにこの混合物を固定円盤ミルですりつぶし、さらにこの粉末を流動床で顆粒化液として水に噴霧して得ることができる。

10

【0108】

f) 水に分散性の顆粒はまた、

重量で25部の式(II) - (VII)および/または群(b)の化合物、または式(I)の除草活性物質と式(II) - (VII)の毒性緩和剤および/または群(b)の物質との活性物質混合物を、

重量で5部のナトリウム2,2 - ジナフチルメタン - 6,6 - ジスルフォネート、

重量で2部のナトリウムオレオイルメチルタウリネート、

重量で1部のポリビニルアルコール、

重量で17部の炭酸カルシウム、および

重量で50部の水をコロイドミルで均質化および予備粉末化し、続いてこの粉末をビーズミルですりつぶし、得られた分散物を噴霧塔で単物質ノズルによって乾燥させて得られる

20

【0109】

生物試験例

1. 被害検定

植物に対する被害を、以下のスケール0 ~ 100%を用いコントロール植物との目による比較で検定する：

0% = 未処理植物と比較して顕著な影響はない、

100% = 処理植物が枯れる。

2. 発芽前の除草剤作用および毒性緩和剤の作用

作物植物の単子葉および双子葉雑草の種子を直径9cmのプラスチック植木鉢中の砂を含むローム土壌に静置し、土壌で被覆した。また別に、水田条件下でコメの栽培中に見つかった雑草を検査のために水に浸かった土壌で栽培する。この植木鉢は、水が土壌の表面に達するか、または表面が数ミリメートル水に浸されるような量の水で満たされている。本発明の除草剤と毒性緩和剤の活性物質配合物を続いて被覆土壌の表面に300L/ha(変換された値)の水の適用率で乳剤形で適用するか、またはコメの場合は灌漑水に加える(各々の事例で種々の用量で)。これらの配合物は乳剤濃縮物として製剤化され、さらに平行実験における個々の活性物質も同じように製剤化される。

30

【0110】

処置後、植木鉢を温室に静置し、良好な成育条件下で保持する。3 - 4週の検査期間後に検査植物が発芽した後で、植物に対する損害、または発芽に対する損害を未処置コントロールと目で比較することによって検定する。検査結果に示したように、本発明の除草剤組成物は、広い範囲の単子葉(grass)雑草および双子葉雑草に対して良好な発芽前除草作用を示し、一方、トウモロコシ、コメ、コムギもしくはオオムギまたは他の穀類のような作物植物に対する損害は、毒性緩和剤なしに個々の除草剤を用いた場合と比較して顕著に低下する。すなわち、除草剤による損害は30%から100%低下する。

40

【0111】

3. 発芽後の除草剤作用および毒性緩和剤作用

単子葉および双子葉の雑草植物および作物植物の種子をプラスチック植木鉢中の砂を含むローム土壌に静置し、土壌で被覆して良好な成育条件下で温室で成育させる。また別に、コメの栽培中に見つかった雑草およびコメを、水田条件下での検査のために、土壌表面が

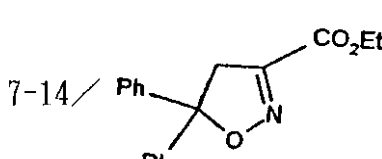
50

2 cmまで水に浸かった植木鉢で育成させ、成育期間中栽培する。播種後約3週間経ってから、検査植物を3枚葉ステージで処置する。本発明の除草剤と毒性緩和剤の活性物質配合物(これは乳剤濃縮物として製剤化されている)、および平行実験では個々の活性物質(同じように製剤化されている)を植物の緑色部分に種々の濃度で、300 L/ha(変換された値)の水の適用率で噴霧する。検査植物を理想的な成育条件下で3週間温室に置いた後、生成物の作用を未処置コントロールと目で比較することによって検定する。コメまたはコメの栽培中に見つかった雑草の場合は、活性物質はまた灌漑用水に直接添加するか(いわゆる顆粒適用と呼ばれるものと同じように適用)、または植物上および灌漑用水中に噴霧する。結果として、特に表17および18に示したものは、本発明の除草剤組成物は、広い範囲の単子葉雑草および双子葉雑草に対して良好な発芽後除草活性を示し、一方、トウモロコシ、コメ、コムギもしくはオオムギまたは他の穀類のような作物植物に対する損害は、毒性緩和剤なしに個々の除草剤を用いた場合と比較して顕著に低下することを示している。すなわち、除草剤による損害は30%から100%低下する。

【0112】

【表17】

表 17

化合物番号 除草剤/毒性緩和剤	用量(g/ha)		コムギにおける被害(%) 品種 "RALLE"	
	除草剤	毒性緩和剤		
7-14	50		30	
	25		25	
7-14 / 	50	+	50	5
	25	+	25	0

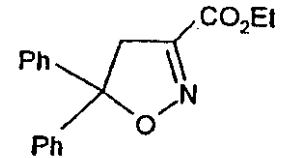
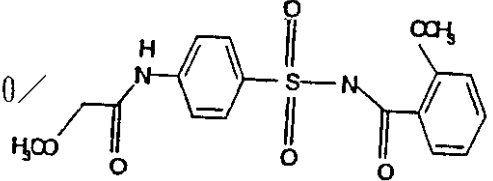
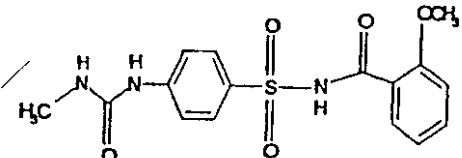
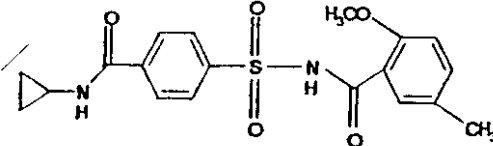
【0113】

【表18】

10

20

表 18

化合物番号 除草剤／毒性緩和剤	用量 (g/ha)		トウモロコシに おける被害 (%)		
	除草剤	毒性緩和剤	品種 "FELIX"	品種 "DEA"	
5-10	200		88	25	
	100		65	10	
	50		30	0	10
5-10 / 	200	+	100	40	0
	50	+	25	0	0
5-10 / 	200	+	100	20	0
	100	+	50	0	0
					20
5-10 / 	200	+	100	30	0
	50	+	25	0	0
5-10 / 	200	+	100	5	0
	50	+	25	0	0
					30

## フロントページの続き

(51)Int.Cl. F I  
 A 0 1 P 13/00 (2006.01) A 0 1 P 13/00

- (72)発明者 フランク・ツィーマー  
 ドイツ連邦共和国デー - 6 5 8 3 0 クリフテル・ウーラントシュトラッセ 2
- (72)発明者 ロータール・ヴィルムス  
 ドイツ連邦共和国デー - 6 5 7 1 9 ホーフハイム・ケーニヒシュタイナーシュトラッセ 5 0
- (72)発明者 ヘルマン・ビーリング  
 ドイツ連邦共和国デー - 6 5 8 1 7 エブシュタイン・アイヒェンヴェーク 2 6
- (72)発明者 エルヴィーン・ハッカー  
 ドイツ連邦共和国デー - 6 5 2 3 9 ホーホハイム・マルガレーテンシュトラッセ 1 6

審査官 福島 芳隆

- (56)参考文献 特開平 0 1 - 1 1 7 8 0 3 ( J P , A )  
 特開平 0 2 - 1 7 4 7 5 4 ( J P , A )  
 特開平 0 5 - 2 7 9 2 0 4 ( J P , A )  
 特表平 0 9 - 5 0 4 0 0 7 ( J P , A )  
 特表平 1 0 - 5 0 5 0 9 9 ( J P , A )  
 特表 2 0 0 1 - 5 1 8 4 6 1 ( J P , A )  
 国際公開第 9 6 / 0 1 4 7 4 7 ( W O , A 1 )  
 国際公開第 9 6 / 0 2 5 4 1 3 ( W O , A 1 )  
 国際公開第 9 7 / 0 0 1 5 5 0 ( W O , A 1 )  
 国際公開第 9 7 / 0 1 3 7 6 5 ( W O , A 1 )  
 国際公開第 9 7 / 0 4 5 0 1 6 ( W O , A 1 )

## (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

A01N 25/32  
 A01N 41/06  
 A01N 43/18  
 A01N 43/80  
 A01N 47/30  
 CApIus(STN)  
 REGISTRY(STN)