

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2013-540113

(P2013-540113A)

(43) 公表日 平成25年10月31日(2013.10.31)

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
CO7D 413/04 (2006.01)	CO7D 413/04 CSP	4C050
AO1N 43/84 (2006.01)	AO1N 43/84 101	4C063
AO1N 43/90 (2006.01)	AO1N 43/90 103	4C065
AO1N 47/42 (2006.01)	AO1N 43/90 104	4C072
AO1P 13/00 (2006.01)	AO1N 47/42 Z	4H011
	審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全 107 頁) 最終頁に続く	

(21) 出願番号 特願2013-530689 (P2013-530689)
 (86) (22) 出願日 平成23年9月26日 (2011. 9. 26)
 (85) 翻訳文提出日 平成25年5月21日 (2013. 5. 21)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2011/066628
 (87) 国際公開番号 W02012/041789
 (87) 国際公開日 平成24年4月5日 (2012. 4. 5)
 (31) 優先権主張番号 10185431.3
 (32) 優先日 平成22年10月1日 (2010. 10. 1)
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)
 (31) 優先権主張番号 61/388, 620
 (32) 優先日 平成22年10月1日 (2010. 10. 1)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

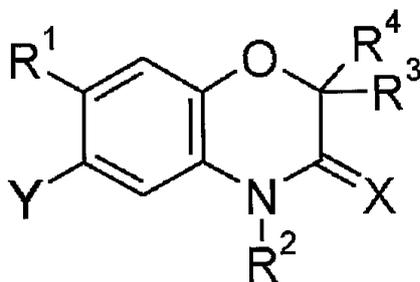
(71) 出願人 508020155
 ビーイーエスエフ ソシエタス・ヨーロッパ
 ア
 BASF SE
 ドイツ連邦共和国 ルートヴィヒスハーフェン
 (番地なし)
 D-67056 Ludwigshafen,
 Germany
 (74) 代理人 100091096
 弁理士 平木 祐輔
 (74) 代理人 100118773
 弁理士 藤田 節
 (74) 代理人 100122389
 弁理士 新井 栄一

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 除草性ベンゾオキサジノン

(57) 【要約】

本発明は、式 I



(I)



(II)

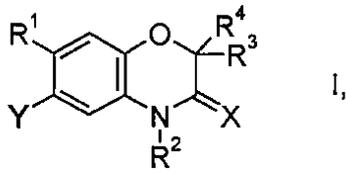
[式中、R¹ は水素又はハロゲンであり；R² は水素、C₁ ~ C₆ - アルキル、C₁ ~ C₆ - ハロアルキル、C₃ ~ C₆ - シクロアルキル、C₃ ~ C₆ - アルケニル、C₃ ~ C₆ - ハロアルケニル、C₃ ~ C₆ - アルキニル、C₃ ~ C₆ - ハロアルキニル、C₁ ~ C₆ - アルコキシ又はC₃ ~ C₆ - シクロアルキル - C₁ ~ C₆ - アルキルであり；R³ はハロゲンであり；R⁴ はハロゲンであり；XはO又はSであり；Yは置換又は無置換の複素環である]

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

【化 1】



【式中、

R¹ は水素又はハロゲンであり；

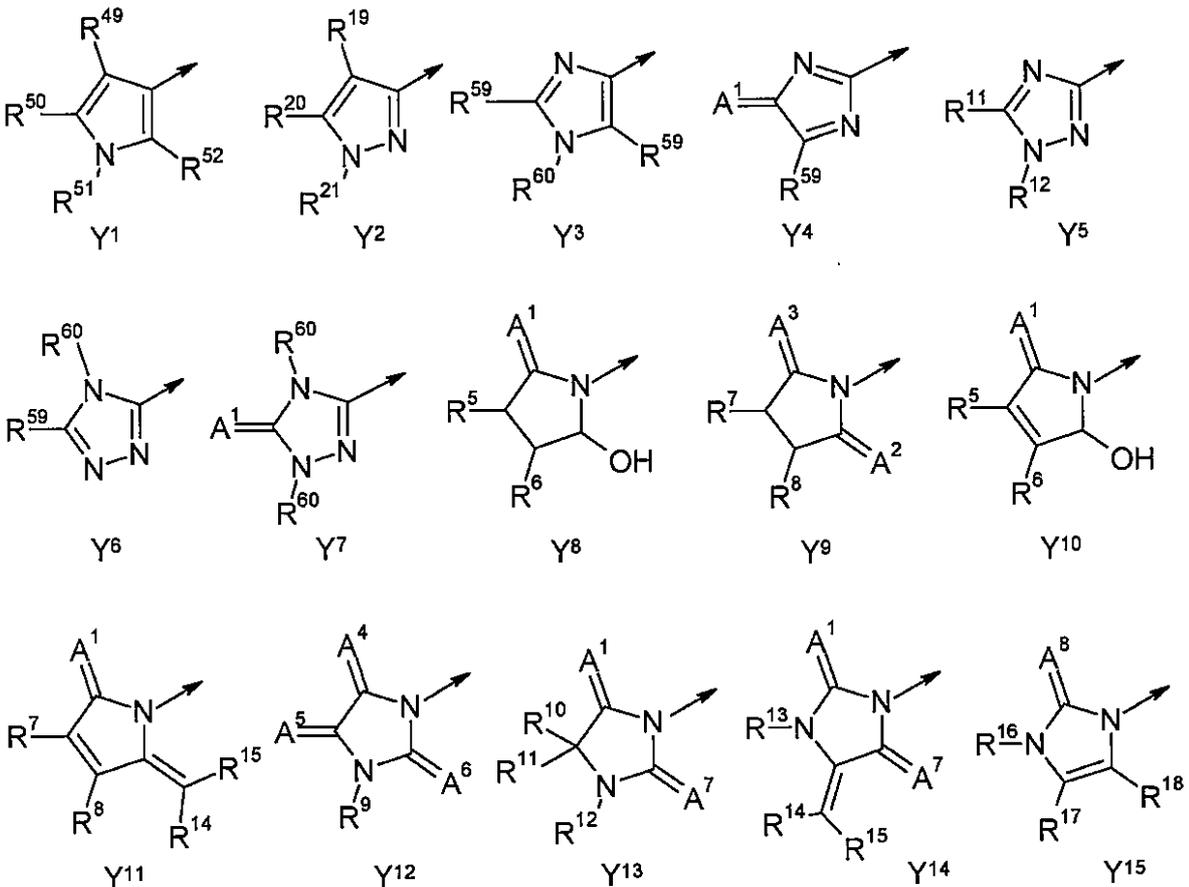
R² は水素、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、C₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-アルケニル、C₃～C₆-ハロアルケニル、C₃～C₆-アルキニル、C₃～C₆-ハロアルキニル、C₁～C₆-アルコキシ又はC₃～C₆-シクロアルキル-C₁～C₆-アルキルであり；

R³ はハロゲンであり；R⁴ はハロゲンであり；

X はO又はSであり；

Y はY¹～Y⁶⁶；

【化 2】

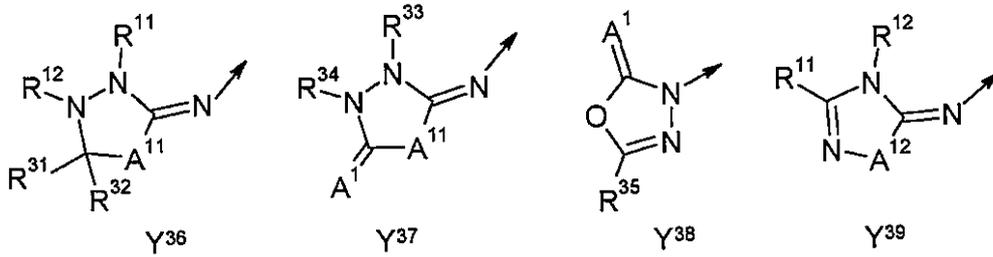
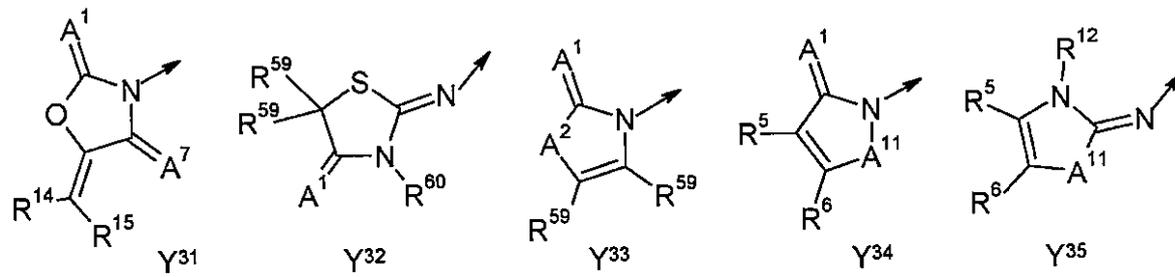
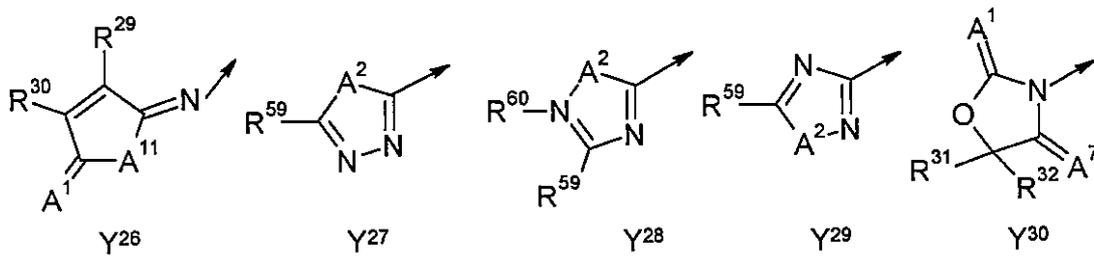
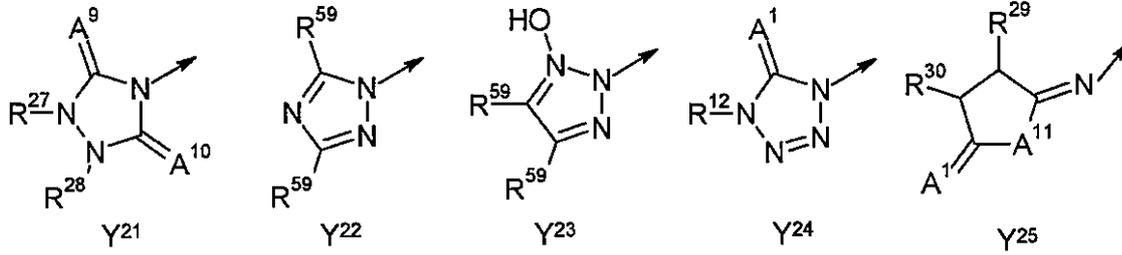
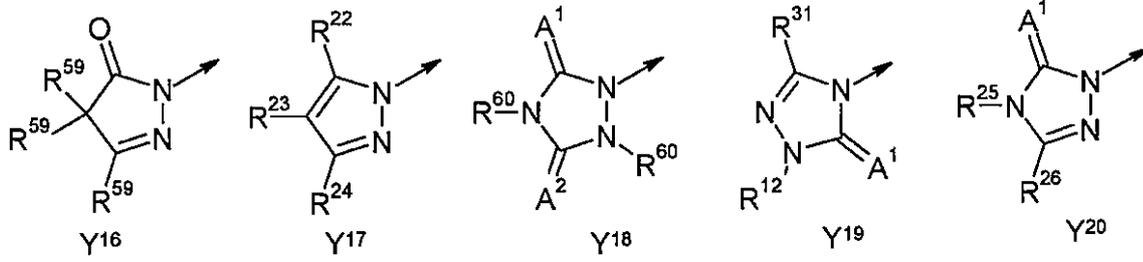


10

20

30

40

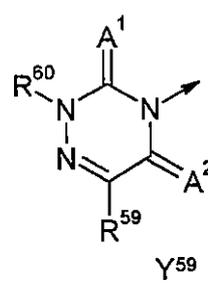
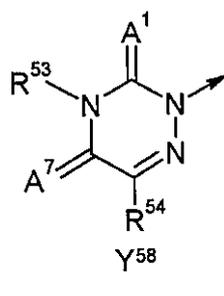
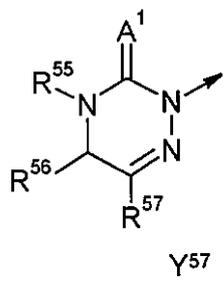
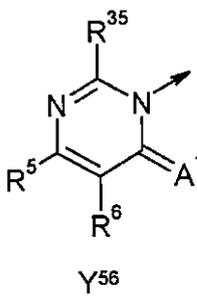
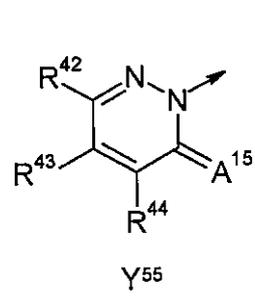
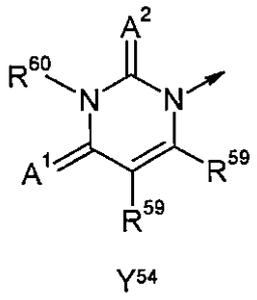
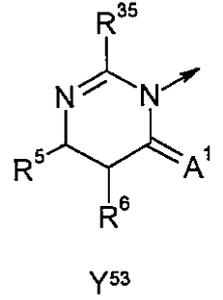
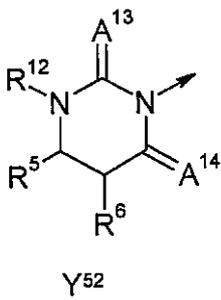
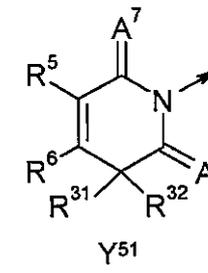
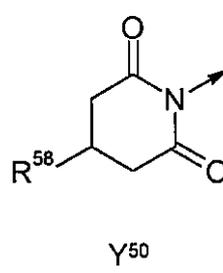
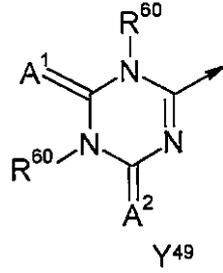
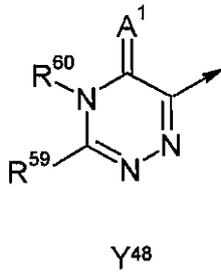
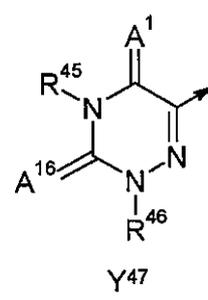
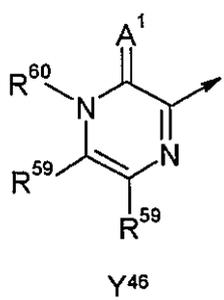
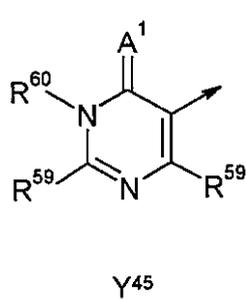
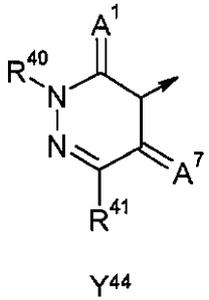
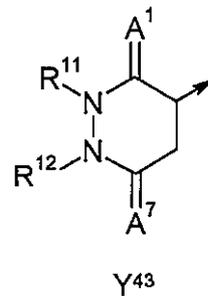
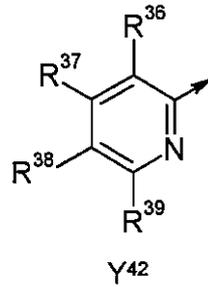
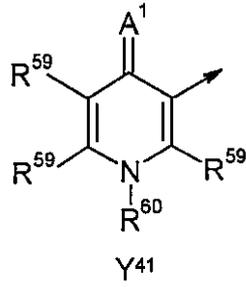
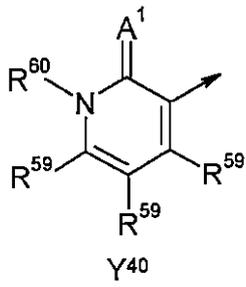


10

20

30

40

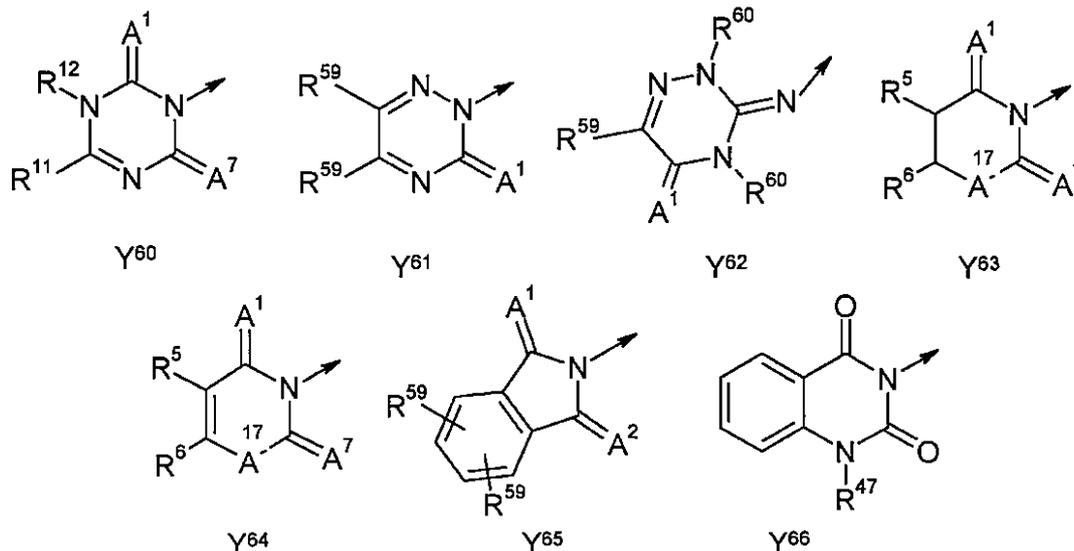


10

20

30

40



10

(式中、

A¹ ~ A¹⁰ は酸素又は硫黄であり；A¹¹ は酸素、硫黄、SO又はSO₂であり；A¹² ~ A¹⁷ は酸素又は硫黄であり；

R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R²³、R²⁴、R²⁹、R³⁰、R³⁷、R³⁸、R³⁹、R⁴³、R⁴⁴、R⁵⁶及びR⁵⁸は、水素、ヒドロキシ、C₁ ~ C₆-アルキル、C₁ ~ C₆-ハロアルキル、C₃ ~ C₇-シクロアルキル、C₃ ~ C₇-シクロアルキルオキシ、C₁ ~ C₆-アルコキシ、C₁ ~ C₆-ハロアルコキシ、C₂ ~ C₆-アルケニル、C₂ ~ C₆-ハロアルケニル、C₂ ~ C₆-アルケニルオキシ、C₃ ~ C₆-アルキニル、C₃ ~ C₆-アルキニルオキシ、C₁ ~ C₆-アルキルチオ、C₁ ~ C₆-アルキルスルフィニル、C₁ ~ C₆-アルキルスルホニル、C₁ ~ C₆-アルコキシスルホニル、C₁ ~ C₆-アルキルスルホニルオキシ、アミノ、C₁ ~ C₆-アルキルアミノ又はジ(C₁ ~ C₆-アルキル)アミノであるか、又は、

R⁵及びR⁶、R⁷及びR⁸、R²³及びR²⁴又はR²⁹及びR³⁰は、それらが結合する原子と一緒に3 ~ 6員環を形成し、該環は飽和、部分不飽和又は芳香族であり、炭素原子とは別に1 ~ 4個の窒素原子、又は1若しくは2個の酸素原子、又は1若しくは2個の硫黄原子、又は1 ~ 3個の窒素原子及び1個の酸素原子、又は1 ~ 3個の窒素原子及び1個の硫黄原子、又は1個の硫黄原子及び1個の酸素原子を含んでいてもよく、その部分が部分的に又は完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/又はC₁ ~ C₆-アルキル及びC₁ ~ C₆-アルコキシからなる群から選択される1 ~ 3個の基によって置換されていてもよい；

R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹⁶、R¹⁷、R²⁰、R²¹、R²⁵、R²⁶、R²⁷、R²⁸、R³³、R³⁴、R⁴⁰、R⁴⁵、R⁴⁶、R⁵⁰、R⁵¹、R⁵³及びR⁵⁵は、水素、シアノ、ヒドロキシ、C₁ ~ C₆-アルキル、C₁ ~ C₆-シアノアルキル、C₁ ~ C₆-ハロアルキル、C₃ ~ C₇-シクロアルキル、C₃ ~ C₇-シクロアルキルオキシ、C₁ ~ C₆-アルコキシ、C₁ ~ C₆-ハロアルコキシ、C₂ ~ C₆-アルケニル、C₂ ~ C₆-ハロアルケニル、C₂ ~ C₆-アルケニルオキシ、C₃ ~ C₆-アルキニル、C₃ ~ C₆-アルキニルオキシ、C₁ ~ C₆-アルキルスルフィニル、C₁ ~ C₆-アルキルスルホニル、フェニル、C₁ ~ C₆-アルキル、アミノ、C₁ ~ C₆-アルキルアミノ又はジ(C₁ ~ C₆-アルキル)アミノであるか、又は、

R¹¹及びR¹²、R¹⁶及びR¹⁷、R²⁵及びR²⁶、R²⁷及びR²⁸又はR³³及びR³⁴は、それらが結合する原子と一緒に3 ~ 6員環を形成し、該環は飽和、部分不飽和又は芳香族であり、炭素原子とは別に1 ~ 4個の窒素原子、又は1若しくは2個の酸素原子、又は1若しくは2個の硫黄原子、又は1 ~ 3個の窒素原子及び1個の酸素原子、又は1 ~ 3個の窒素原子及び1個の硫黄原子、又は1個の硫黄原子及び1個の酸素原子

50

を含んでいてもよく、その部分が部分的に又は完全にハロゲン化されていてもよく、かつ / 又は $C_1 \sim C_6$ - アルキル及び $C_1 \sim C_6$ - アルコキシからなる群から選択される 1 ~ 3 個の基によって置換されていてもよく；

R^{13} は、水素、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ - アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノ又はジ ($C_1 \sim C_6$ - アルキル) アミノであり；

R^{14} 、 R^{15} 、 R^{18} 、 R^{22} 、 R^{31} 及び R^{32} は、水素、ハロゲン又は $C_1 \sim C_6$ - アルキルであり；

R^{19} 、 R^{35} 、 R^{36} 、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{49} 、 R^{52} 、 R^{54} 及び R^{57} は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ - アルキニル又は $C_3 \sim C_6$ - アルキニルオキシであり；

R^{47} は、水素、 NH_2 、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル又は $C_3 \sim C_6$ - アルキニルであり；

R^{59} は、水素、アミノ、ニトロ、シアノ、カルボキシ、カルバモイル、チオカルバモイル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ - アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニルチオ、 $C_3 \sim C_6$ - アルキニルチオ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノ、ジ ($C_1 \sim C_6$ - アルキル) アミノ又は $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_3$ - アルキルであり；

R^{60} は、水素、ヒドロキシル、アミノ、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ - アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノ、ジ ($C_1 \sim C_6$ - アルキル) アミノ、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_3$ - アルキル、フェニル又はフェニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキルであり；

ここで、 Y が Y^2 又は Y^{20} である場合、 R^3 及び R^4 はいずれもハロゲンである) からなる群から選択される置換基である]

で表されるベンゾオキサジノン (その農薬として許容される塩も含まれる) 。

【請求項 2】

R^1 がハロゲンである、請求項 1 に記載の式 I で表されるベンゾオキサジノン。

【請求項 3】

R^2 が $C_3 \sim C_6$ - アルキニル又は $C_3 \sim C_6$ - ハロアルキニルである、請求項 1 又は 2 に記載の式 I で表されるベンゾオキサジノン。

【請求項 4】

Y が Y^2 、 Y^{42} 又は Y^5 である、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の式 I で表されるベンゾオキサジノン。

【請求項 5】

請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の式 I で表される少なくとも 1 種のベンゾオキサジノンの除草活性量と、除草剤 B 及び / 又はセーフナー C の群から選択される少なくとも 1 種の別の活性化合物とを含む除草剤組成物。

【請求項 6】

除草剤 B 及び / 又はセーフナー C の群から選択される少なくとも 2 種の別の活性化合物を含んでいる、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 7】

請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の式 I で表される少なくとも 1 種のベンゾオキサジ

10

20

30

40

50

ノンの除草活性量、又は請求項 5 若しくは 6 に記載の除草剤組成物と、少なくとも 1 種の不活性液体及び / 又は固体担体と、適切であれば少なくとも 1 種の界面活性物質とを含む除草剤組成物。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の式 I で表される少なくとも 1 種のベンゾオキサジノンの除草活性量、又は請求項 5 若しくは 6 に記載の除草剤組成物と、少なくとも 1 種の不活性液体及び / 又は固体担体と、望ましい場合は少なくとも 1 種の界面活性物質とを混合することを含む、除草活性組成物の調製方法。

【請求項 9】

請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の式 I で表される少なくとも 1 種のベンゾオキサジノンの除草活性量、又は請求項 5、6 若しくは 7 に記載の除草剤組成物を、植物、その環境又は種子に作用させることを含む、望まれていない植物の防除方法。

10

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、以下に定義される一般式 I で表されるベンゾオキサジノン及びその除草剤としての使用に関する。さらに、本発明は、作物保護用組成物及び不要植物の防除方法に関する。

【背景技術】

【0002】

例えば、WO90/10626 及び WO97/07104 は、特に、除草活性が明記されている構造的に類似の化合物を記載しているが、これは本発明によるベンゾオキサジノン I とは、ベンゾ [1,4] オキサジン環が 2 位において好ましくは無置換であるという点で異なっており、一方、本発明による式 I で表されるベンゾオキサジノンは 2 位において少なくとも 1 個のハロゲン原子で置換されている。

20

【0003】

しかしながら、有害植物に対するこの既知化合物の除草特性は必ずしもまったく満足のいくものではない。

【先行技術文献】

【特許文献】

30

【0004】

【特許文献 1】WO90/10626

【特許文献 2】WO97/07104

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0005】

したがって、本発明の目的は、改善された除草活性を有しているベンゾオキサジノンを提供することにある。提供されるのは、特に、特に低施用量でも高い除草活性を有し、また商業利用の作物植物と十分適合性のあるベンゾオキサジノンである。

【課題を解決するための手段】

40

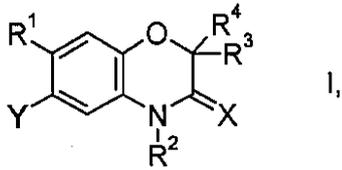
【0006】

これらの目的及び別の目的は、以下に定義される、式 I で表されるベンゾオキサジノン及びその農薬として適する塩によって達成される。

【0007】

つまり、本発明は、式 I

【化 1】



【 0 0 0 8 】

[式中、

R¹ は水素又はハロゲンであり；

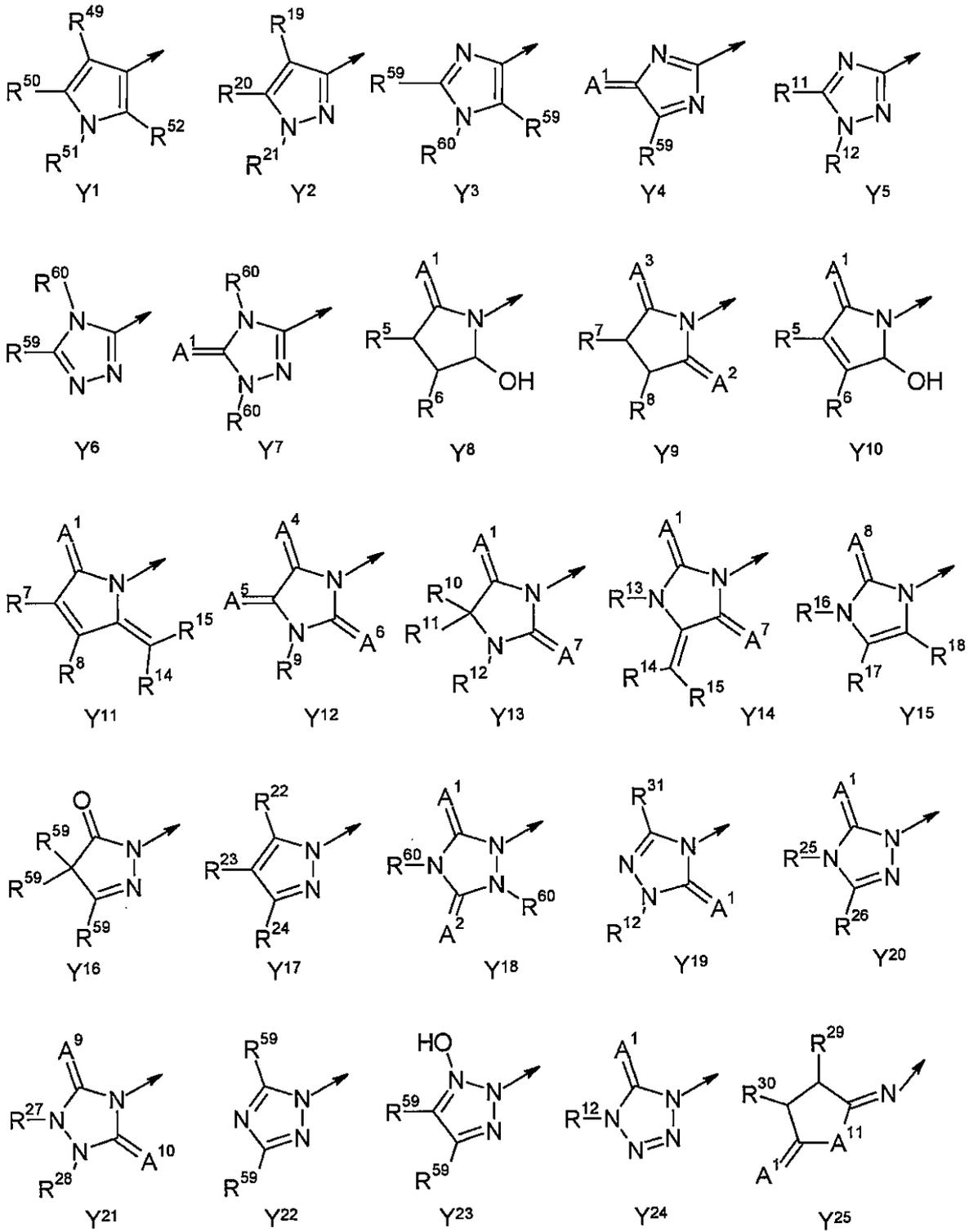
R² は水素、C₁ ~ C₆ - アルキル、C₁ ~ C₆ - ハロアルキル、C₃ ~ C₆ - シクロアルキル、C₃ ~ C₆ - アルケニル、C₃ ~ C₆ - ハロアルケニル、C₃ ~ C₆ - アルキニル、C₃ ~ C₆ - ハロアルキニル、C₁ ~ C₆ - アルコキシ又はC₃ ~ C₆ - シクロアルキル - C₁ ~ C₆ - アルキルであり；

R³ は水素又はハロゲンであり；R⁴ はハロゲンであり；

X は O 又は S であり；

Y は Y¹ ~ Y⁶ であり；

【化 2】

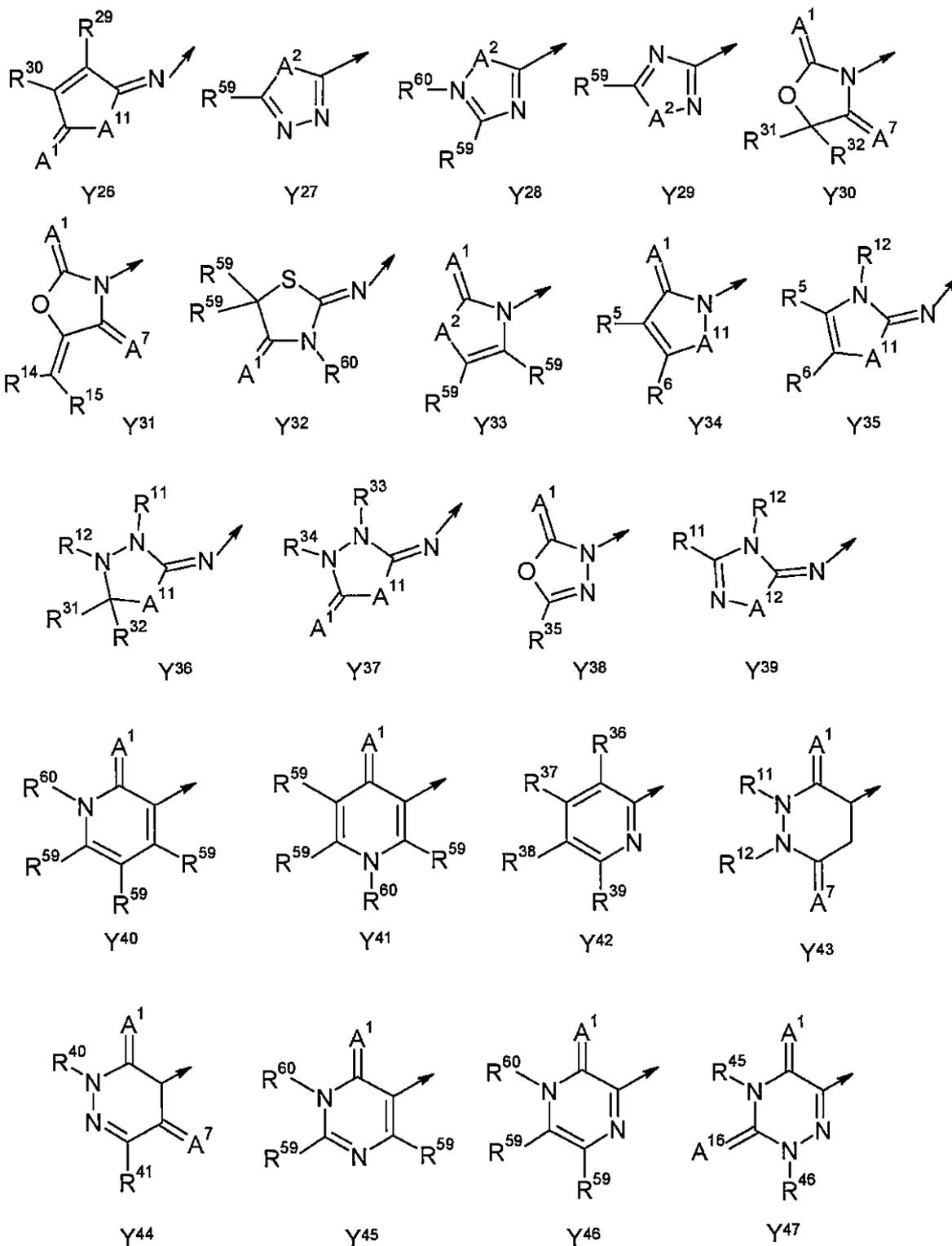


10

20

30

40

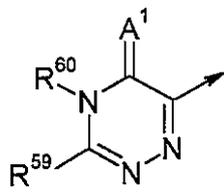


10

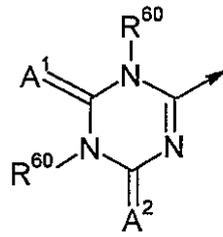
20

30

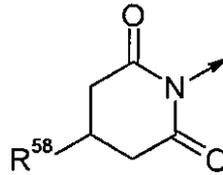
40



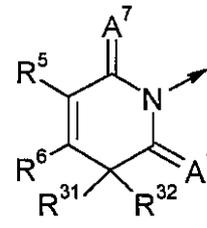
Y48



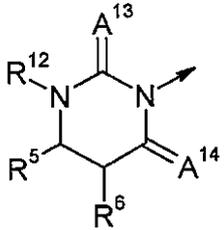
Y49



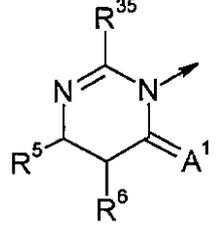
Y50



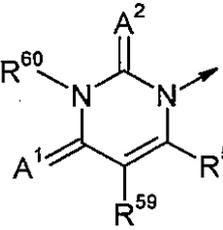
Y51



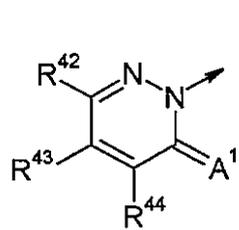
Y52



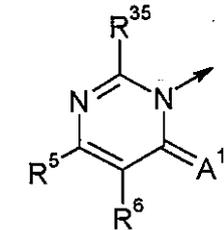
Y53



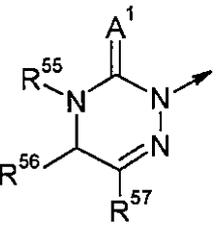
Y54



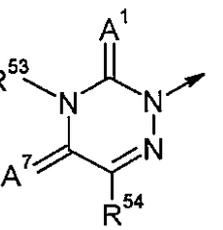
Y55



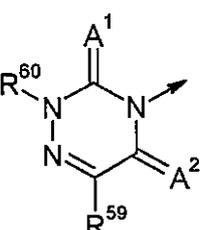
Y56



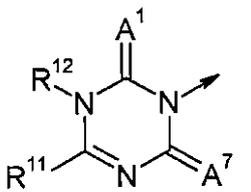
Y57



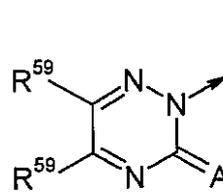
Y58



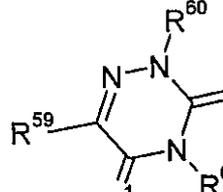
Y59



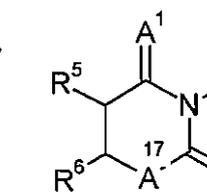
Y60



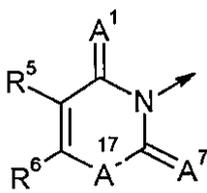
Y61



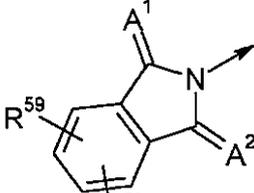
Y62



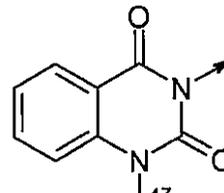
Y63



Y64



Y65



Y66

10

20

30

40

50

【 0 0 0 9 】

(式 中、

A¹ ~ A¹⁰ は酸素又は硫黄であり；A¹¹ は酸素、硫黄、SO又はSO₂であり；A¹² ~ A¹⁷ は酸素又は硫黄であり；

R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R²³、R²⁴、R²⁹、R³⁰、R³⁷、R³⁸、R³⁹、
 R⁴³、R⁴⁴、R⁵⁶及びR⁵⁸は、水素、ヒドロキシ、C₁ ~ C₆-アルキル、C₁ ~ C₆-ハロアルキル、C₃ ~ C₇-シクロアルキル、C₃ ~ C₇-シクロアルキルオキシ、C₁ ~ C₆-アルコキシ、C₁ ~ C₆-ハロアルコキシ、C₂ ~ C₆-アルケニル

、 $C_2 \sim C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ - アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルスルホニルオキシ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノ又はジ($C_1 \sim C_6$ - アルキル)アミノであるか、又は、

R^5 及び R^6 、 R^7 及び R^8 、 R^{23} 及び R^{24} 又は R^{29} 及び R^{30} は、それらが結合する原子と一緒に 3 ~ 6 員環を形成し、該環は飽和、部分不飽和又は芳香族であり、炭素原子とは別に 1 ~ 4 個の窒素原子、又は 1 若しくは 2 個の酸素原子、又は 1 若しくは 2 個の硫黄原子、又は 1 ~ 3 個の窒素原子及び 1 個の酸素原子、又は 1 ~ 3 個の窒素原子及び 1 個の硫黄原子、又は 1 個の硫黄原子及び 1 個の酸素原子を含んでいてもよく、その部分が部分的に又は完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/又は $C_1 \sim C_6$ - アルキル及び $C_1 \sim C_6$ - アルコキシからなる群から選択される 1 ~ 3 個の基によって置換されていてもよく；

R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{16} 、 R^{17} 、 R^{20} 、 R^{21} 、 R^{25} 、 R^{26} 、 R^{27} 、 R^{28} 、 R^{33} 、 R^{34} 、 R^{40} 、 R^{45} 、 R^{46} 、 R^{50} 、 R^{51} 、 R^{53} 及び R^{55} は、水素、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ - アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルスルホニル、フェニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノ又はジ($C_1 \sim C_6$ - アルキル)アミノであるか、又は、

R^{11} 及び R^{12} 、 R^{16} 及び R^{17} 、 R^{25} 及び R^{26} 、 R^{27} 及び R^{28} 又は R^{33} 及び R^{34} は、それらが結合する原子と一緒に 3 ~ 6 員環を形成し、該環は飽和、部分不飽和又は芳香族であり、炭素原子とは別に 1 ~ 4 個の窒素原子、又は 1 若しくは 2 個の酸素原子、又は 1 若しくは 2 個の硫黄原子、又は 1 ~ 3 個の窒素原子及び 1 個の酸素原子、又は 1 ~ 3 個の窒素原子及び 1 個の硫黄原子、又は 1 個の硫黄原子及び 1 個の酸素原子を含んでいてもよく、その部分が部分的に又は完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/又は $C_1 \sim C_6$ - アルキル及び $C_1 \sim C_6$ - アルコキシからなる群から選択される 1 ~ 3 個の基によって置換されていてもよく；

R^{13} は、水素、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ - アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノ又はジ($C_1 \sim C_6$ - アルキル)アミノであり；

R^{14} 、 R^{15} 、 R^{18} 、 R^{22} 、 R^{31} 及び R^{32} は、水素、ハロゲン又は $C_1 \sim C_6$ - アルキルであり；

R^{19} 、 R^{35} 、 R^{36} 、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{49} 、 R^{52} 、 R^{54} 及び R^{57} は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ - アルキニル又は $C_3 \sim C_6$ - アルキニルオキシであり；

R^{47} は、水素、 NH_2 、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル又は $C_3 \sim C_6$ - アルキニルであり；

R^{59} は、水素、アミノ、ニトロ、シアノ、カルボキシ、カルバモイル、チオカルバモイル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ - アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニルチオ、 $C_3 \sim C_6$ - アルキニルチオ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノ、ジ($C_1 \sim C_6$ - アルキル)アミノ又は $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C$

10

20

30

40

50

R^3 - アルキルであり；

R^6 は、水素、ヒドロキシル、アミノ、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ - アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノ、ジ($C_1 \sim C_6$ - アルキル)アミノ、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_3$ - アルキル、フェニル又はフェニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキルであり；

ここで、 Y が Y^2 又は Y^{20} である場合、 R^3 及び R^4 はいずれもハロゲンである)からなる群から選択される置換基である]

で表されるベンゾオキサジノン(その農薬として許容される塩も含まれる)を提供するものである。

10

【0010】

本発明は、また、式Iで表される少なくとも1種のベンゾオキサジノン、及び、除草活性化合物B及びセーフナーCから選択される少なくとも1種の別の化合物を含む除草活性組成物を提供するものである。

【0011】

本発明は、また、一般式Iで表されるベンゾオキサジノンの除草剤としての(すなわち有害植物を防除するための)使用を提供するものである。

【0012】

本発明は、また、式Iで表される少なくとも1種のベンゾオキサジノン、及び作物保護剤を製剤化する際に慣用される助剤を含む混合物を提供するものである。

20

【0013】

本発明は、さらに、式Iで表される少なくとも1種のベンゾオキサジノンの除草有効量を植物、その種子及び/又はその生息地に作用させる不要植物の防除方法を提供するものである。施用は、望ましくない植物の発芽の前、発芽中及び/又は発芽後に行うことができる。

【0014】

さらには、本発明は、式Iで表されるベンゾオキサジノンを調製するための方法及び中間体に関する。

【0015】

本発明の別の実施形態は、特許請求の範囲、詳細な説明及び実施例から明らかである。本発明の主題の上述した要件及び以下に今から説明する要件は、それぞれの特定のケースで記載されている組み合わせのみならず他の組み合わせでも本発明の範囲から逸脱することなく施用され得ることは理解されるべきである。

30

【発明を実施するための形態】

【0016】

本明細書で使用される、用語「防除」と「駆除」は、同意語である。

【0017】

本明細書で使用される、用語「望ましくない植物」と「有害植物」は、同意語である。

【0018】

本明細書に記載する式Iで表されるベンゾオキサジノンが幾何異性体(例えばE/Z異性体)を形成し得る場合は、本発明による組成物には、その純粋各異性体及びそれらの混合物のいずれもが用いられ得る。

40

【0019】

本明細書に記載する式Iで表されるベンゾオキサジノンが1個又はそれ以上のキラル中心を有していて、結果として、エナンチオマー又はジアステレオマーとして存在している場合は、本発明に係る組成物において、純粋な各エナンチオマー及びジアステレオマー並びにそれらの混合物のいずれもが用いられ得る。

【0020】

本明細書に記載する式Iで表されるベンゾオキサジノンが、イオン化され得る官能基を

50

有している場合は、その農薬として許容される塩又はそれらの混合物の形態でもそれらは用いることができる。

【0021】

一般的には、活性化合物の活性に悪影響がない（農薬として許容される）カチオンの塩が適している。好ましいカチオンは、アルカリ金属、好ましくはリチウム、ナトリウム及びカリウムのイオン、アルカリ土類金属、好ましくはカルシウム及びマグネシウムのイオン、及び遷移金属、好ましくはマンガン、銅、亜鉛及び鉄のイオン、さらにはアンモニウム並びにその1～4個の水素原子がC₁～C₄-アルキル、ヒドロキシ-C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-アルコキシ-C₁～C₄-アルキル、ヒドロキシ-C₁～C₄-アルコキシ-C₁～C₄-アルキル、フェニル又はベンジルで置換されている置換アンモニウム（以下の本明細書では有機アンモニウムとも呼ばれる）、好ましくはアンモニウム、メチルアンモニウム、イソプロピルアンモニウム、ジメチルアンモニウム、ジイソプロピルアンモニウム、トリメチルアンモニウム、テトラメチルアンモニウム、テトラエチルアンモニウム、テトラブチルアンモニウム、2-ヒドロキシエチルアンモニウム、2-(2-ヒドロキシエトキシ)エタ-1-イルアンモニウム、ジ(2-ヒドロキシエタ-1-イル)アンモニウム、ベンジルトリメチルアンモニウム、ベンジルトリエチルアンモニウム、さらにはホスホニウムイオン、スルホニウムイオン、好ましくはトリ(C₁～C₄-アルキル)スルホニウム、例えばトリメチルスルホニウム、及びスルホキソニウムイオン、好ましくはトリ(C₁～C₄-アルキル)スルホキソニウムである。

10

【0022】

有用な酸付加塩のアニオンは、主なものとしては、クロリド、プロミド、フルオリド、ヨージド、硫酸水素、硫酸メチル、硫酸、リン酸二水素、リン酸水素、硝酸、重炭酸、炭酸、ヘキサフルオロシリケート、ヘキサフルオロホスファート、ベンゾアート並びにC₁～C₄-アルカン酸（好ましくはギ酸、酢酸、プロピオン酸及び酪酸）のアニオンである。

20

【0023】

本明細書に記載の可変部（特にR¹～R^{4,6}に関して）の定義において言及される有機部分は、用語ハロゲンのように、個々の基の構成員を個々に列挙するための集合用語である。用語ハロゲンとは、各場合、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を意味する。すべての炭化水素鎖、すなわちアルキルはすべて直鎖又は分岐であることができ、添え字のC_n～C_mは、各場合、その基中に存在し得る炭素原子の数を意味している。

30

【0024】

そのような意味の例は、

- ・ C₁～C₄-アルキル：例えばCH₃、C₂H₅、n-プロピル、CH(CH₃)₂、n-ブチル、CH(CH₃)-C₂H₅、CH₂-CH(CH₃)₂及びC(CH₃)₃；
- ・ C₁～C₆-アルキル並びにC₁～C₆-シアノアルキル、C₁～C₆-シクロアルキル-C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-アルキルスルフィニル、C₁～C₆-アルキルスルホニル、C₁～C₆-アルキルスルホニルオキシ及びフェニル-C₁～C₆-アルキルのC₁～C₆-アルキル部分：上記したC₁～C₄-アルキル、及び、例えば、n-ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2,2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、n-ヘキシル、1,1-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル又は1-エチル-2-メチルプロピル、好ましくはメチル、エチル、n-プロピル、1-メチルエチル、n-ブチル、1,1-ジメチルエチル、n-ペンチル又はn-ヘキシル；
- ・ C₁～C₄-ハロアルキル：フッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素で部分的又は完全

40

50

に置換されている上記した $C_1 \sim C_4$ - アルキル基、例えば、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、プロモメチル、ヨードメチル、2 - フルオロエチル、2 - クロロエチル、2 - プロモエチル、2 - ヨードエチル、2, 2 - ジフルオロエチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2 - クロロ - 2 - フルオロエチル、2 - クロロ - 2, 2 - ジフルオロエチル、2, 2 - ジクロロ - 2 - フルオロエチル、2, 2, 2 - トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、2 - フルオロプロピル、3 - フルオロプロピル、2, 2 - ジフルオロプロピル、2, 3 - ジフルオロプロピル、2 - クロロプロピル、3 - クロロプロピル、2, 3 - ジクロロプロピル、2 - プロモプロピル、3 - プロモプロピル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、3, 3, 3 - トリクロロプロピル、2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、1 - (フルオロメチル) - 2 - フルオロエチル、1 - (クロロメチル) - 2 - クロロエチル、1 - (プロモメチル) - 2 - プロモエチル、4 - フルオロブチル、4 - クロロブチル、4 - プロモブチル、ノナフルオロブチル、1, 1, 2, 2, - テトラフルオロエチル及び 1 - トリフルオロメチル - 1, 2, 2, 2 - テトラフルオロエチル；

・ $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル及び $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルチオの $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル部分：上記した $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキル、及び、例えば、5 - フルオロペンチル、5 - クロロペンチル、5 - プロモペンチル、5 - ヨードペンチル、ウンデカフルオロペンチル、6 - フルオロヘキシル、6 - クロロヘキシル、6 - プロモヘキシル、6 - ヨードヘキシル及びトリスデカフルオロヘキシル；

・ $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル及び $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_6$ - アルキルのシクロアルキル部分：3 ~ 6 環員を有している単環式飽和炭化水素、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシル；

・ $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル及び $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルオキシのシクロアルキル部分：3 ~ 7 環員を有している単環式飽和炭化水素、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル及びシクロヘプチル；

・ $C_3 \sim C_6$ - アルケニル：例えば 1 - プロペニル、2 - プロペニル、1 - メチルエテニル、1 - ブテニル、2 - ブテニル、3 - ブテニル、1 - メチル - 1 - プロペニル、2 - メチル - 1 - プロペニル、1 - メチル - 2 - プロペニル、2 - メチル - 2 - プロペニル、1 - ペンテニル、2 - ペンテニル、3 - ペンテニル、4 - ペンテニル、1 - メチル - 1 - ブテニル、2 - メチル - 1 - ブテニル、3 - メチル - 1 - ブテニル、1 - メチル - 2 - ブテニル、2 - メチル - 2 - ブテニル、3 - メチル - 2 - ブテニル、1 - メチル - 3 - ブテニル、2 - メチル - 3 - ブテニル、3 - メチル - 3 - ブテニル、1, 1 - ジメチル - 2 - プロペニル、1, 2 - ジメチル - 1 - プロペニル、1, 2 - ジメチル - 2 - プロペニル、1 - エチル - 1 - プロペニル、1 - エチル - 2 - プロペニル、1 - ヘキセニル、2 - ヘキセニル、3 - ヘキセニル、4 - ヘキセニル、5 - ヘキセニル、1 - メチル - 1 - ペンテニル、2 - メチル - 1 - ペンテニル、3 - メチル - 1 - ペンテニル、4 - メチル - 1 - ペンテニル、1 - メチル - 2 - ペンテニル、2 - メチル - 2 - ペンテニル、3 - メチル - 2 - ペンテニル、4 - メチル - 2 - ペンテニル、1 - メチル - 3 - ペンテニル、2 - メチル - 3 - ペンテニル、3 - メチル - 3 - ペンテニル、4 - メチル - 3 - ペンテニル、1 - メチル - 4 - ペンテニル、2 - メチル - 4 - ペンテニル、3 - メチル - 4 - ペンテニル、4 - メチル - 4 - ペンテニル、1, 1 - ジメチル - 2 - ブテニル、1, 1 - ジメチル - 3 - ブテニル、1, 2 - ジメチル - 1 - ブテニル、1, 2 - ジメチル - 2 - ブテニル、1, 2 - ジメチル - 3 - ブテニル、1, 3 - ジメチル - 1 - ブテニル、1, 3 - ジメチル - 2 - ブテニル、1, 3 - ジメチル - 3 - ブテニル、2, 2 - ジメチル - 3 - ブテニル、2, 3 - ジメチル - 1 - ブテニル、2, 3 - ジメチル - 2 - ブテニル、2, 3 - ジメチル - 3 - ブテニル、3, 3 - ジメチル - 1 - ブテニル、3, 3 - ジメチル - 2 - ブテニル、1 - エチル - 1 - ブテニル、1 - エチル - 2 - ブテニル、1 - エチル - 3 - ブテニル、2 - エチル - 1 - ブテニル、2 - エチル - 2 - ブテニル、2 - エチル - 3 - ブテニル、1, 1, 2 - トリメチル - 2 - プロペニル、1 - エチル - 1 - メチル - 2 - プロペニル、1 - エチル -

10

20

30

40

50

- 2 - メチル - 1 - プロピニル及び 1 - エチル - 2 - メチル - 2 - プロピニル ;
- ・ $C_2 \sim C_6$ - アルケニル及び $C_2 \sim C_6$ - アルケニルオキシのアルケニル部分 : 先に言及した $C_3 \sim C_6$ - アルケニル、並びにエテニル ;
 - ・ $C_2 \sim C_6$ - ハロアルケニル : フッ素、塩素、臭素及び / 又はヨウ素によって部分的又は完全に置換されている先に言及した $C_2 \sim C_6$ - アルケニル基、例えば 2 - クロロプロパ - 2 - エン - 1 - イル、3 - クロロプロパ - 2 - エン - 1 - イル、2, 3 - ジクロロプロパ - 2 - エン - 1 - イル、3, 3 - ジクロロプロパ - 2 - エン - 1 - イル、2, 3, 3 - トリクロロ - 2 - エン - 1 - イル、2, 3 - ジクロロブタ - 2 - エン - 1 - イル、2 - プロモプロパ - 2 - エン - 1 - イル、3 - プロモプロパ - 2 - エン - 1 - イル、2, 3 - ジプロモプロパ - 2 - エン - 1 - イル、3, 3 - ジプロモプロパ - 2 - エン - 1 - イル、2, 3, 3 - トリプロモ - 2 - エン - 1 - イル又は 2, 3 - ジプロモブタ - 2 - エン - 1 - イル ;
 - ・ $C_3 \sim C_6$ - アルキニル並びに $C_3 \sim C_6$ - アルキニルオキシの $C_3 \sim C_6$ - アルキニル部分 : 例えば 1 - プロピニル、2 - プロピニル、1 - ブチニル、2 - ブチニル、3 - ブチニル、1 - メチル - 2 - プロピニル、1 - ペンチニル、2 - ペンチニル、3 - ペンチニル、4 - ペンチニル、1 - メチル - 2 - ブチニル、1 - メチル - 3 - ブチニル、2 - メチル - 3 - ブチニル、3 - メチル - 1 - ブチニル、1, 1 - ジメチル - 2 - プロピニル、1 - エチル - 2 - プロピニル、1 - ヘキシニル、2 - ヘキシニル、3 - ヘキシニル、4 - ヘキシニル、5 - ヘキシニル、1 - メチル - 2 - ペンチニル、1 - メチル - 3 - ペンチニル、1 - メチル - 4 - ペンチニル、2 - メチル - 3 - ペンチニル、2 - メチル - 4 - ペンチニル、3 - メチル - 1 - ペンチニル、3 - メチル - 4 - ペンチニル、4 - メチル - 1 - ペンチニル、4 - メチル - 2 - ペンチニル、1, 1 - ジメチル - 2 - ブチニル、1, 1 - ジメチル - 3 - ブチニル、1, 2 - ジメチル - 3 - ブチニル、2, 2 - ジメチル - 3 - ブチニル、3, 3 - ジメチル - 1 - ブチニル、1 - エチル - 2 - ブチニル、1 - エチル - 3 - ブチニル、2 - エチル - 3 - ブチニル及び 1 - エチル - 1 - メチル - 2 - プロピニル ;
 - ・ $C_3 \sim C_6$ - ハロアルキニル : フッ素、塩素、臭素及び / 又はヨウ素によって部分的又は完全に置換されている先に言及した $C_3 \sim C_6$ - アルキニル基、例えば 1, 1 - ジフルオロプロパ - 2 - イン - 1 - イル、3 - クロロプロパ - 2 - イン - 1 - イル、3 - プロモプロパ - 2 - イン - 1 - イル、3 - ヨードプロパ - 2 - イン - 1 - イル、4 - フルオロブタ - 2 - イン - 1 - イル、4 - クロロブタ - 2 - イン - 1 - イル、1, 1 - ジフルオロブタ - 2 - イン - 1 - イル、4 - ヨードブタ - 3 - イン - 1 - イル、5 - フルオロペンタ - 3 - イン - 1 - イル、5 - ヨードペンタ - 4 - イン - 1 - イル、6 - フルオロヘックス - 4 - イン - 1 - イル又は 6 - ヨードヘックス - 5 - イン - 1 - イル ;
 - ・ $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ : 例えばメトキシ、エトキシ、プロポキシ、1 - メチルエトキシプトキシ、1 - メチルプロポキシ、2 - メチルプロポキシ及び 1, 1 - ジメチルエトキシ ;
 - ・ $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ並びに $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシスルホニルの $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ部分 : 先に言及した $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、並びに、例えば、ペントキシ、1 - メチルプトキシ、2 - メチルプトキシ、3 - メトキシルプトキシ、1, 1 - ジメチルプロポキシ、1, 2 - ジメチルプロポキシ、2, 2 - ジメチルプロポキシ、1 - エチルプロポキシ、ヘキソキシ、1 - メチルペントキシ、2 - メチルペントキシ、3 - メチルペントキシ、4 - メチルペントキシ、1, 1 - ジメチルプトキシ、1, 2 - ジメチルプトキシ、1, 3 - ジメチルプトキシ、2, 2 - ジメチルプトキシ、2, 3 - ジメチルプトキシ、3, 3 - ジメチルプトキシ、1 - エチルプトキシ、2 - エチルプトキシ、1, 1, 2 - トリメチルプロポキシ、1, 2, 2 - トリメチルプロポキシ、1 - エチル - 1 - メチルプロポキシ及び 1 - エチル - 2 - メチルプロポキシ ;
 - ・ $C_1 \sim C_4$ - アルキルチオ : 例えばメチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、1 - メチルエチルチオ、ブチルチオ、1 - メチルプロピルチオ、2 - メチルプロピルチオ及び 1, 1 - ジメチルエチルチオ ;
 - ・ $C_1 \sim C_6$ - アルキルチオ : 先に言及した $C_1 \sim C_4$ - アルキルチオ、並びに、例え

ば、ペンチルチオ、1 - メチルブチルチオ、2 - メチルブチルチオ、3 - メチルブチルチオ、2, 2 - ジメチルプロピルチオ、1 - エチルプロピルチオ、ヘキシルチオ、1, 1 - ジメチルプロピルチオ、1, 2 - ジメチルプロピルチオ、1 - メチルペンチルチオ、2 - メチルペンチルチオ、3 - メチルペンチルチオ、4 - メチルペンチルチオ、1, 1 - ジメチルブチルチオ、1, 2 - ジメチルブチルチオ、1, 3 - ジメチルブチルチオ、2, 2 - ジメチルブチルチオ、2, 3 - ジメチルブチルチオ、3, 3 - ジメチルブチルチオ、1 - エチルブチルチオ、2 - エチルブチルチオ、1, 1, 2 - トリメチルプロピルチオ、1, 2, 2 - トリメチルプロピルチオ、1 - エチル - 1 - メチルプロピルチオ及び1 - エチル - 2 - メチルプロピルチオ；

・ $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノ：例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、1 - メチルエチルアミノ、ブチルアミノ、1 - メチルプロピルアミノ、2 - メチルプロピルアミノ、1, 1 - ジメチルエチルアミノ、ペンチルアミノ、1 - メチルブチルアミノ、2 - メチルブチルアミノ、3 - メチルブチルアミノ、2, 2 - ジメチルプロピルアミノ、1 - エチルプロピルアミノ、ヘキシルアミノ、1, 1 - ジメチルプロピルアミノ、1, 2 - ジメチルプロピルアミノ、1 - メチルペンチルアミノ、2 - メチルペンチルアミノ、3 - メチルペンチルアミノ、4 - メチルペンチルアミノ、1, 1 - ジメチルブチルアミノ、1, 2 - ジメチルブチルアミノ、1, 3 - ジメチルブチルアミノ、2, 2 - ジメチルブチルアミノ、2, 3 - ジメチルブチルアミノ、3, 3 - ジメチルブチルアミノ、1 - エチルブチルアミノ、2 - エチルブチルアミノ、1, 1, 2 - トリメチルプロピルアミノ、1, 2, 2 - トリメチルプロピルアミノ、1 - エチル - 1 - メチルプロピルアミノ又は1 - エチル - 2 - メチルプロピルアミノ；

・ ジ ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) アミノ：例えば、N, N - ジメチルアミノ、N, N - ジエチルアミノ、N, N - ジプロピルアミノ、N, N - ジ (1 - メチルエチル) アミノ、N, N - ジブチルアミノ、N, N - ジ (1 - メチルプロピル) アミノ、N, N - ジ (2 - メチルプロピル) アミノ、N, N - ジ (1, 1 - ジメチルエチル) アミノ、N - エチル - N - メチルアミノ、N - メチル - N - プロピルアミノ、N - メチル - N - (1 - メチルエチル) アミノ、N - ブチル - N - メチルアミノ、N - メチル - N - (1 - メチルプロピル) アミノ、N - メチル - N - (2 - メチルプロピル) アミノ、N - (1, 1 - ジメチルエチル) - N - メチルアミノ、N - エチル - N - プロピルアミノ、N - エチル - N - (1 - メチルエチル) アミノ、N - ブチル - N - エチルアミノ、N - エチル - N - (1 - メチルプロピル) アミノ、N - エチル - N - (2 - メチルプロピル) アミノ、N - エチル - N - (1, 1 - ジメチルエチル) アミノ、N - (1 - メチルエチル) - N - プロピルアミノ、N - ブチル - N - プロピルアミノ、N - (1 - メチルプロピル) - N - プロピルアミノ、N - (2 - メチルプロピル) - N - プロピルアミノ、N - (1, 1 - ジメチルエチル) - N - プロピルアミノ、N - ブチル - N - (1 - メチルエチル) アミノ、N - (1 - メチルエチル) - N - (2 - メチルプロピル) アミノ、N - (1, 1 - ジメチルエチル) - N - (1 - メチルエチル) アミノ、N - ブチル - N - (1 - メチルプロピル) アミノ、N - ブチル - N - (2 - メチルプロピル) アミノ、N - ブチル - N - (1, 1 - ジメチルエチル) アミノ、N - (1 - メチルプロピル) - N - (2 - メチルプロピル) アミノ、N - (1, 1 - ジメチルエチル) - N - (1 - メチルプロピル) アミノ及びN - (1, 1 - ジメチルエチル) - N - (2 - メチルプロピル) アミノ；

・ ジ ($C_1 \sim C_6$ - アルキル) アミノ：先に言及したジ ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) アミノ、及び、例えば、N, N - ジペンチルアミノ、N, N - ジヘキシルアミノ、N - メチル - N - ペンチルアミノ、N - エチル - N - ペンチルアミノ、N - メチル - N - ヘキシルアミノ及びN - エチル - N - ヘキシルアミノ；

・ 飽和、部分不飽和又は芳香族であり、炭素原子とは別に1 ~ 4個の窒素原子、又は1若しくは2個の酸素原子、又は1若しくは2個の硫黄原子、又は1 ~ 3個の窒素原子及び1個の酸素原子、又は1 ~ 3個の窒素原子及び1個の硫黄原子、又は1個の硫黄原子及び1個の酸素原子を含んでいてもよい3 ~ 6員環：例えば、

10

20

30

40

50

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル；

1 - シクロプロペニル、2 - シクロプロペニル、1 - シクロブテニル、2 - シクロブテニル、1 - シクロペンテニル、2 - シクロペンテニル、1, 3 - シクロペンタジエニル、1, 4 - シクロペンタジエニル、2, 4 - シクロペンタジエニル、1 - シクロヘキセニル、2 - シクロヘキセニル、3 - シクロヘキセニル、1, 3 - シクロヘキサジエニル、1, 4 - シクロヘキサジエニル、2, 5 - シクロヘキサジエニル；フェニル；

オキシラニル、オキセタニル、アジリジニル、チイラニル、チエタニル、アゼチジニル、アゼチニル；

テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、ピロリジニル、イソオキサゾリジニル、イソチアゾリジニル、ピラゾリジニル、オキサゾリジニル、チアゾリジニル、イミダゾリジニル、トリアゾリジニル、オキサジアゾリジニル、チアジアゾリジニル；

ジヒドロフリル、ジオキサラニル、ジヒドロチエニル、ジヒドロピロリル、ジヒドロイソオキサゾール、ジヒドロイソチアゾリル、ジヒドロピラゾリル、ジヒドロイミダゾリル、ジヒドロオキサゾリル、ジヒドロチアゾリル；

フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾール、トリアゾリル、テトラゾリル；

ペリジニル、ジオキサニル、ジチアニル、ジチアニル、オキサチアニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ヘキサヒドロピリダジニル、ヘキサヒドロピリミジニル、ペラジニル、ヘキサヒドロトリアジニル、テトラヒドロオキサジニル、モルホリニル；

ピラニル、チオピラニル、ジヒドロオキサジニル、ジヒドロピラニル、ジヒドロチオピラニル、テトラヒドロピリジニル、ジヒドロピリジニル、ジヒドロチアジニル、テトラヒドロピリダジニル、テトラヒドロピリミジニル、テトラヒドロピラジニル、オキサジニル、チアジニル、ジヒドロピリダジニル、ジヒドロピラジニル、ジヒドロピリミジニル；

ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジン、ピラジニル、トリアジニル、テトラジニル。

【0025】

本明細書で言及される本発明の好ましい実施形態は、好ましくは互いに独立して又は互いに組み合わせられるものとして理解されなければならない。

【0026】

本発明の好ましい実施形態によれば、各可変部が、互いに独立して又は互いとの組み合わせで以下の意味を有している、式 I で表されるベンゾオキサジノンも好ましい：

R^1 は水素であり、

また好ましくはハロゲンであり、

特に好ましくは F 又は Cl であり、

非常に好ましいのは F であり；

R^2 は $C_3 \sim C_6$ - アルキニル又は $C_3 \sim C_6$ - ハロアルキニルであり、

好ましくは C_3 - アルキニル又は C_3 - ハロアルキニルであり、

特に好ましくは $CH_2C(CH_3)CH_2$ 、 $CH_2C(CH_3)CH_2Cl$ 又は $CH_2C(CH_3)CH_2Br$ であり、

また好ましくは $C_3 \sim C_6$ - アルキニル又は $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_6$ - アルキルであり、

特に好ましくはプロパルギル又はシクロプロピルメチルであり、

また好ましくは $C_3 \sim C_6$ - アルキニル、好ましくは C_3 - アルキニルであり、特に好ましくは $CH_2C(CH_3)CH_2$ であり、

また好ましくは $C_3 \sim C_6$ - ハロアルキニル、好ましくは C_3 - ハロアルキニルであり、

特に好ましくは $CH_2C(CH_3)CH_2Cl$ 又は $CH_2C(CH_3)CH_2Br$ であり；

R^3 は水素であり、

また好ましくはハロゲン、特に好ましくは F 又は Cl であり、より好ましくは Cl であり、

また好ましくはハロゲン、特に好ましくは F であり、

10

20

30

40

50

また好ましくは水素又はFであり；

R⁴は水素であり；

また好ましくはハロゲン、特に好ましくはF又はClであり、より好ましくはClであり、

また好ましくはハロゲン、特に好ましくはFであり、

また好ましくは水素又はFであり、

XはOであり、

また好ましくはSであり、

Yは好ましくはY²、Y¹³、Y¹²、Y²⁰、Y³¹、Y³⁷、Y³⁸、Y³⁹、Y⁴²、Y⁵⁵又はY⁶⁶であり、

より好ましくはY¹²、Y¹³、Y²⁰、Y³¹、Y³⁷、Y³⁸、Y³⁹、Y⁵⁵又はY⁶⁶であり、

さらにより好ましくはY²、Y⁴²、Y⁵⁵であり、

最も好ましくはY⁵⁵であり；

A¹～A¹⁰は、好ましくは酸素であり、

また好ましくは硫黄であり；

A¹¹は、好ましくは酸素又は硫黄であり、

より好ましくは酸素であり、

さらにより好ましくは硫黄であり、

また好ましくは酸素、SO又はSO₂であり、

また好ましくは硫黄、SO又はSO₂であり、

またより好ましくはSO又はSO₂であり；

A¹²～A¹⁷は好ましくは酸素であり、

また好ましくは硫黄であり；

R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R²³、R²⁴、R²⁹、R³⁰、R³⁷、R³⁸、R³⁹、R⁴³、R⁴⁴、R⁵⁶及びR⁵⁸は、好ましくはC₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、アルキルチオ、C₁～C₆-、C₁～C₆-アルキルスルホニルであるか、又はR⁵及びR⁶、R⁷及びR⁸、R²³及びR²⁴又はR²⁹及びR³⁰は、それらが結合する原子と一緒に5～6員環を形成し、該環は飽和、部分不飽和又は芳香族であり、炭素原子とは別に、1～4個の窒素原子、又は1個の酸素原子、又は1個の硫黄原子を含んでいてもよく、その部分が部分的に又は完全にハロゲン化されていてもよく、かつ/又は1～3個のC₁～C₆-アルキル基で置換されていてもよく；

より好ましくは、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキルであるか、又はR⁵及びR⁶、R⁷及びR⁸、R²及びR²⁴又はR²⁹及びR³⁰は、それらが結合する原子と一緒に5～6員環を形成し、該環は飽和、部分不飽和又は芳香族であり、その部分が1又は2個のハロゲン原子、好ましくはフッ素で置換されていてもよく、かつ/又は1～3個のC₁～C₄-アルキル基、好ましくはメチルで置換されていてもよく；

特に好ましくは、C₁～C₆-アルキル又はC₁～C₆-ハロアルキルであり；

また、特に好ましくは、R⁵及びR⁶、R⁷及びR⁸、R²³及びR²⁴又はR²⁹及びR³⁰は、それらが結合する原子と一緒に5～6員環を形成し、該環は飽和、部分不飽和又は芳香族であり、その部分が1又は2個のハロゲン原子、好ましくはフッ素で置換されていてもよく、かつ/又は1～3個のC₁～C₄-アルキル基、好ましくはメチルで置換されていてもよく；

R³⁸及びR⁴³は最も好ましくはC₁～C₆-ハロアルキルであり；

R⁴⁴は最も好ましくはCH₃であり；

R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹⁶、R¹⁷、R²⁰、R²¹、R²⁵、R²⁶、R²⁷、R²⁸、R³³、R³⁴、R⁴⁰、R⁴⁵、R⁴⁶、R⁵⁰、R⁵¹、R⁵³及びR⁵⁵は、

好ましくは、水素、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、C₁～C₆-アルコキシ、C₁～C₆-ハロアルコキシ、C₁～C₆-アルキルスルフィニル、C₁～

10

20

30

40

50

C_6 - アルキルスルホニルであるか、又は、 R^{11} 及び R^{12} 、 R^{16} 及び R^{17} 、 R^{25} 及び R^{26} 、 R^{27} 及び R^{28} 又は R^{33} 及び R^{34} は、それらが結合する原子と一緒に
なって 5 ~ 6 員環を形成し、該環は飽和、部分不飽和又は芳香族であり、炭素原子とは
別に、1 ~ 4 個の窒素原子、又は 1 若しくは 2 個の酸素原子、又は 1 若しくは 2 個の硫黄
原子を含んでいてもよく、その部分が部分的に又は完全にハロゲン化されていてもよく；

さらに好ましくは、水素、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルスルホニルであるか、又は R^{11} 及び R^{12} 、 R^{16} 及び R^{17} 、 R^{25}
及び R^{26} 、 R^{27} 及び R^{28} 又は R^{33} 及び R^{34} は、それらが結合する原子と一緒に
なって 5 ~ 6 員環を形成し、該環は飽和、部分不飽和又は芳香族であり、その部分が 1 又
は 2 個のハロゲン原子、好ましくはフッ素で置換されていてもよく、かつ / 又は 1 ~ 3 個
の $C_1 \sim C_4$ - アルキル基、好ましくはメチルで置換されていてもよく；

特に好ましくは水素、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ - アルキルスルホニルであり；

R^{20} は最も好ましくは CF_3 、 $OCHF_2$ であり；

R^{21} は最も好ましくは Cl 、 Br 、 CH_3 であり；

また、特に好ましくは、 R^{11} 及び R^{12} 、 R^{16} 及び R^{17} 、 R^{25} 及び R^{26} 、 R^{27}
及び R^{28} 又は R^{33} 及び R^{34} は、それらが結合する原子と一緒になって 5 ~ 6 員
環を形成し、該環は飽和、部分不飽和又は芳香族であり、その部分が 1 又は 2 個のハロゲ
ン原子、好ましくはフッ素で置換されていてもよく、かつ / 又は 1 ~ 3 個の $C_1 \sim C_4$ -
アルキル基、好ましくはメチルで置換されていてもよく；

R^{13} は好ましくは $C_1 \sim C_6$ - アルキル又は $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルであり；

R^{14} 、 R^{15} 、 R^{18} 、 R^{22} 、 R^{31} 及び R^{32} は好ましくは水素、ハロゲン又は
 $C_1 \sim C_6$ - アルキルであり；

より好ましくはハロゲン又は $C_1 \sim C_6$ - アルキルであり；

最も好ましくはハロゲンであり；

また最も好ましくは $C_1 \sim C_6$ - アルキルであり；

また最も好ましくは水素であり；

R^{19} 、 R^{35} 、 R^{36} 、 R^{41} 、 R^{42} 、 R^{49} 、 R^{52} 、 R^{54} 及び R^{57} は、好
ましくは水素、ハロゲン又は $C_1 \sim C_6$ - アルキルであり；

より好ましくはハロゲン又は $C_1 \sim C_6$ - アルキルであり；

最も好ましくはハロゲンであり；

また最も好ましくは $C_1 \sim C_6$ - アルキルであり；

また最も好ましくは水素であり；

R^{36} は最も好ましくは F 、 Cl であり；

R^{47} は好ましくは $C_1 \sim C_6$ - アルキルであり；

R^{59} は好ましくは水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル又は $C_1 \sim C_6$ - ハロアル
キルであり；

より好ましくは $C_1 \sim C_6$ - アルキルであり、

R^{60} は好ましくは水素、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル又は $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキ
ルであり；

より好ましくは $C_1 \sim C_6$ - アルキルである。

【0027】

特に好ましいのは、 X が O であり、 Y が Y^{55} (A^{15} が O であり、 R^{42} が H であり
、 R^{43} が CF_3 であり、 R^{44} が CH_3 である) である式 I で表されるベンゾオキサジ
ノンであり、これは本明細書においては式 Ia：

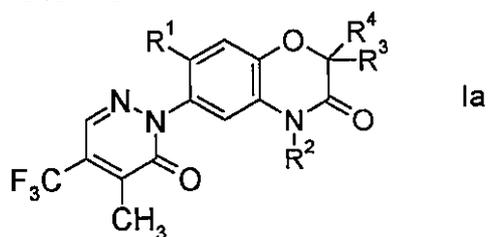
10

20

30

40

【化3】



【0028】

[式中の変数部 R¹、R²、R³ 及び R⁴ は先に定義した意味 (特にはその好ましい意味) を有している] で表されるベンゾオキサジノンとも呼ばれる。

10

【0029】

非常に好ましいのは表 A の式 Ia 1 ~ Ia 60 で表されるベンゾオキサジノンであり、ここで、変数部 R¹、R²、R³ 及び R⁴ の定義は、互いの組み合わせのみならず、各場合、それ自体でも本発明の化合物には特別な意義がある :

【表1】

表A

番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
Ia1	H	H	H	F
Ia2	H	CH ₃	H	F
Ia3	H	C ₂ H ₅	H	F
Ia4	H	CH ₂ -C ₂ H ₅	H	F
Ia5	H	CH(CH ₃) ₂	H	F

番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
Ia6	H	CH ₂ -CH ₂ -(CH ₃) ₂	H	F
Ia7	H	CH ₂ -CH=CH ₂	H	F
Ia8	H	CH ₂ C≡CH	H	F
Ia9	H	CH ₂ C≡C-Cl	H	F
Ia10	H	CH ₂ C≡C-Br	H	F

20

番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
la11	F	H	H	F
la12	F	CH ₃	H	F
la13	F	C ₂ H ₅	H	F
la14	F	CH ₂ -C ₂ H ₅	H	F
la15	F	CH(CH ₃) ₂	H	F
la16	F	CH ₂ -CH ₂ -(CH ₃) ₂	H	F
la17	F	CH ₂ -CH=CH ₂	H	F
la18	F	CH ₂ C≡CH	H	F
la19	F	CH ₂ C=C-Cl	H	F
la20	F	CH ₂ C=C-Br	H	F
la21	Cl	H	H	F
la22	Cl	CH ₃	H	F
la23	Cl	C ₂ H ₅	H	F
la24	Cl	CH ₂ -C ₂ H ₅	H	F
la25	Cl	CH(CH ₃) ₂	H	F
la26	Cl	CH ₂ -CH ₂ -(CH ₃) ₂	H	F
la27	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂	H	F
la28	Cl	CH ₂ C≡CH	H	F
la29	Cl	CH ₂ C=C-Cl	H	F
la30	Cl	CH ₂ C=C-Br	H	F
la31	H	H	F	F
la32	H	CH ₃	F	F
la33	H	C ₂ H ₅	F	F
la34	H	CH ₂ -C ₂ H ₅	F	F
la35	H	CH(CH ₃) ₂	F	F

番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
la36	H	CH ₂ -CH ₂ -(CH ₃) ₂	F	F
la37	H	CH ₂ -CH=CH ₂	F	F
la38	H	CH ₂ C≡CH	F	F
la39	H	CH ₂ C≡C-Cl	F	F
la40	H	CH ₂ C≡C-Br	F	F
la41	F	H	F	F
la42	F	CH ₃	F	F
la43	F	C ₂ H ₅	F	F
la44	F	CH ₂ -C ₂ H ₅	F	F
la45	F	CH(CH ₃) ₂	F	F
la46	F	CH ₂ -CH ₂ -(CH ₃) ₂	F	F
la47	F	CH ₂ -CH=CH ₂	F	F
la48	F	CH ₂ C≡CH	F	F
la49	F	CH ₂ C≡C-Cl	F	F
la50	F	CH ₂ C≡C-Br	F	F
la51	Cl	H	F	F
la52	Cl	CH ₃	F	F
la53	Cl	C ₂ H ₅	F	F
la54	Cl	CH ₂ -C ₂ H ₅	F	F
la55	Cl	CH(CH ₃) ₂	F	F
la56	Cl	CH ₂ -CH ₂ -(CH ₃) ₂	F	F
la57	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂	F	F
la58	Cl	CH ₂ C≡CH	F	F
la59	Cl	CH ₂ C≡C-Cl	F	F
la60	Cl	CH ₂ C≡C-Br	F	F

10

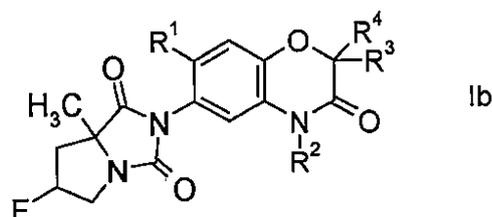
20

30

【0030】

また、対応する式 Ia 1 ~ Ia 60 のベンゾオキサジノンとは Y が Y¹³ (式中、A¹ 及び A⁷ が O であり、R¹⁰ が CH₃ であり、R¹¹ 及び R¹² が一緒に - (CH₂ - CHF - CH₂) - を形成し、好ましくは R¹¹ 及び R¹² が一緒に (6S, 7aR) 立体異性体を形成する) であるという点でのみ異なっている式 Ib :

【化4】



40

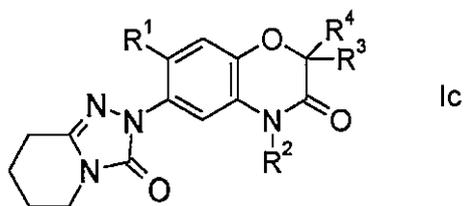
【0031】

で表されるベンゾオキサジノンも好ましい (特に好ましくは式 Ib 1 ~ Ib 60 のベンゾオキサジノン)。

【0032】

また、対応する式 Ia 1 ~ Ia 60 のベンゾオキサジノンとは Y が Y²⁰ (式中、A¹ が O であり、R²⁵ 及び R²⁶ が一緒に - (CH₂)₄ - を形成する) であるという点でのみ異なっている式 Ic :

【化5】



【0033】

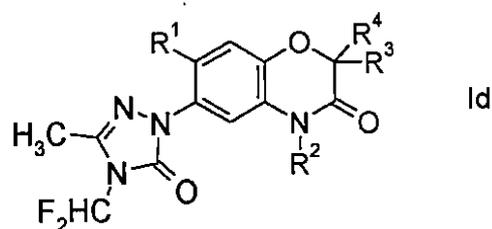
で表されるベンゾオキサジノンも好ましい（特に好ましくは式 Ic 1 ~ Ic 60 のベンゾオキサジノン）。

10

【0034】

また、対応する式 Ia 1 ~ Ia 60 のベンゾオキサジノンとは Y が Y²⁰（式中、A¹ が O であり、R²⁵ が CHF₂ であり、R²⁶ が CH₃ である）であるという点でのみ異なっている式 Id :

【化6】



20

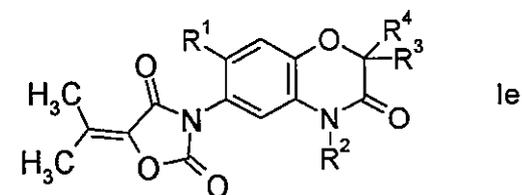
【0035】

で表されるベンゾオキサジノンも好ましい（特に好ましくは式 Id 1 ~ Id 60 のベンゾオキサジノン）。

【0036】

また、対応する式 Ia 1 ~ Ia 60 のベンゾオキサジノンとは Y が Y³¹（式中、A¹ 及び A⁷ が O であり、R¹⁴ 及び R¹⁵ が CH₃ である）であるという点でのみ異なっている式 Ie :

【化7】



30

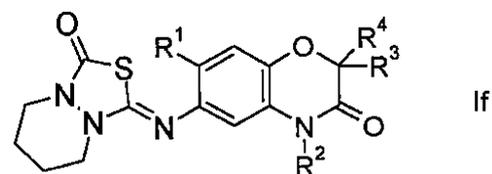
【0037】

で表されるベンゾオキサジノンも好ましい（特に好ましくは式 Ie 1 ~ Ie 60 のベンゾオキサジノン）。

【0038】

また、対応する式 Ia 1 ~ Ia 60 のベンゾオキサジノンとは Y が Y³⁷（式中、A¹ が O であり、A¹¹ が S であり、R³³ 及び R³⁴ が一緒に - (CH₂)₄ - を形成する）であるという点でのみ異なっている式 If :

【化8】



40

【0039】

50

で表されるベンゾオキサジノンも好ましい（特に好ましくは式 I f 1 ~ I f 6 0 のベンゾオキサジノン）。

【0040】

また、対応する式 I a 1 ~ I a 6 0 のベンゾオキサジノンとは Y が Y^{3 8}（式中、A¹が O であり、R^{3 5}が C(CH₃)₃である）であるという点でのみ異なっている式 I g

：



10

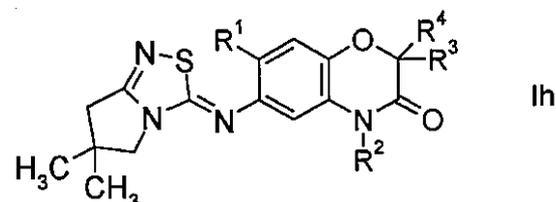
【0041】

で表されるベンゾオキサジノンも好ましい（特に好ましくは式 I g 1 ~ I g 6 0 のベンゾオキサジノン）。

【0042】

また、対応する式 I a 1 ~ I a 6 0 のベンゾオキサジノンとは Y が Y^{3 9}（式中、A^{1 2}が S であり、R^{1 1}及び R^{1 2}と一緒に -CH₂-C(CH₃)₂-CH₂-を形成する）であるという点でのみ異なっている式 I h

20



【0043】

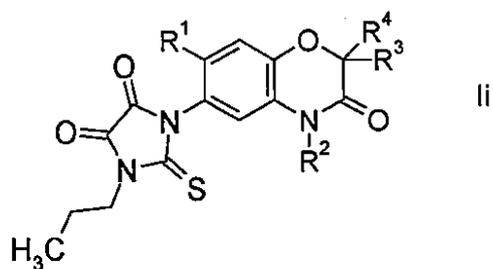
で表されるベンゾオキサジノンも好ましい（特に好ましくは式 I h 1 ~ I h 6 0 のベンゾオキサジノン）。

30

【0044】

また、対応する式 I a 1 ~ I a 6 0 のベンゾオキサジノンとは Y が Y^{1 2}（式中、A⁴、A⁵及び A⁶が O であり、R⁹が -CH₂-CH₂-CH₃である）であるという点でのみ異なっている式 I i

【化11】



40

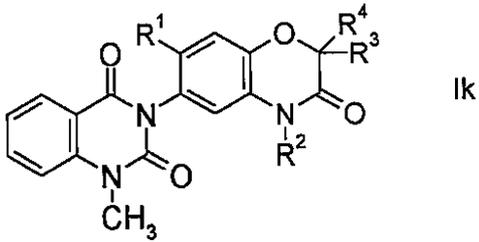
【0045】

で表されるベンゾオキサジノンも好ましい（特に好ましくは式 I i 1 ~ I i 6 0 のベンゾオキサジノン）。

【0046】

また、対応する式 I a 1 ~ I a 6 0 のベンゾオキサジノンとは Y が Y^{6 6}（式中、R^{4 7}が CH₃であり、R^{4 8}が H である）であるという点でのみ異なっている式 I k

【化12】



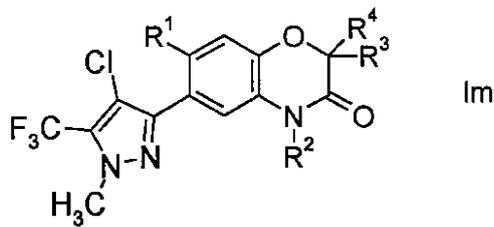
【0047】

で表されるベンゾオキサジノンも好ましい（特に好ましくは式Ik1～Ik60のベンゾオキサジノン）。

【0048】

また、対応する式Ia1～Ia60のベンゾオキサジノンとはYがY²（式中、R¹⁹がClであり、R²⁰がCF₃であり、R²¹がCH₃である）であるという点でのみ異なっている式Im：

【化13】



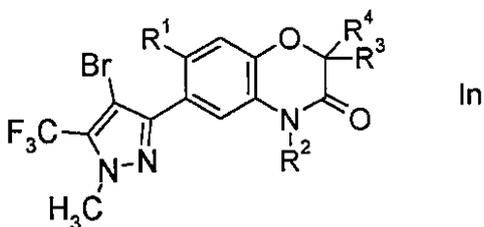
【0049】

で表されるベンゾオキサジノンも好ましい（特に好ましくは式Im1～Im60のベンゾオキサジノン）。

【0050】

また、対応する式Ia1～Ia60のベンゾオキサジノンとはYがY²（式中、R¹⁹がBrであり、R²⁰がCF₃であり、R²¹がCH₃である）であるという点でのみ異なっている式In：

【化14】



【0051】

で表されるベンゾオキサジノンも好ましい（特に好ましくは式In1～In60のベンゾオキサジノン）。

【0052】

また、対応する式Ia1～Ia60のベンゾオキサジノンとはYがY²（式中、R¹⁹がClであり、R²⁰がOCHF₂であり、R²¹がCH₃である）であるという点でのみ異なっている式Io：

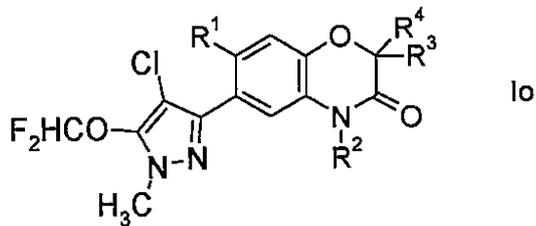
10

20

30

40

【化15】



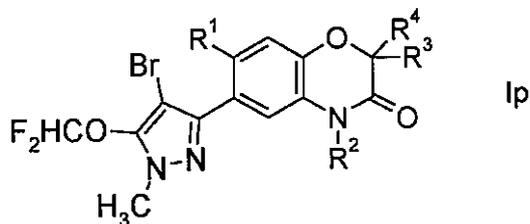
【0053】

で表されるベンゾオキサジノンも好ましい（特に好ましくは式Io1～Io60のベンゾオキサジノン）。

【0054】

また、対応する式Ia1～Ia60のベンゾオキサジノンとはYがY²（式中、R¹⁹がBrであり、R²⁰がOCHF₂であり、R²¹がCH₃である）であるという点でのみ異なっている式Ip：

【化16】



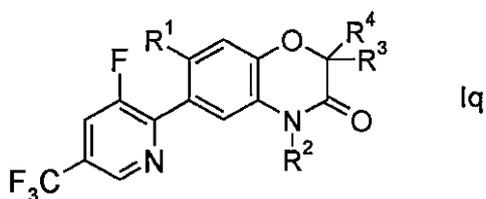
【0055】

で表されるベンゾオキサジノンも好ましい（特に好ましくは式Ip1～Ip60のベンゾオキサジノン）。

【0056】

また、対応する式Ia1～Ia60のベンゾオキサジノンとはYがY⁴²（式中、R³⁶がFであり、R³⁷がHであり、R³⁸がCF₃であり、R³⁹がHである）であるという点でのみ異なっている式Iq：

【化17】



【0057】

で表されるベンゾオキサジノンも好ましい（特に好ましくは式Iq1～Iq60のベンゾオキサジノン）。

【0058】

また、対応する式Ia1～Ia60のベンゾオキサジノンとはYがY¹³（式中、A¹及びA⁷がOであり、R¹⁰が水素であり、R¹¹及びR¹²が-(CH₂-CHF-CH₂)-を一緒に形成し、好ましくはR¹¹及びR¹²が(6S, 7aR)立体異性体を一緒に形成する）であるという点でのみ異なっている式Ir：

10

20

30

40

、例えば酢酸エチル、酢酸プロピル、イソ酪酸メチル、酢酸イソブチル、カルボキサミド、例えばN, N - ジメチルホルムアミド、N - メチルピロリドン、N, N - ジメチルアセトアミド、ニトリル、例えばアセトニトリル及びプロピオニトリル、アルコール、例えばメタノール、エタノール、n - プロパノール、イソプロパノール、n - ブタノール及びtert - ブタノールである。特に好ましいのはトルエン及びメタノールである。記載した溶媒の混合物も用いることができる。

【0065】

後処理は公知の方法で行うことができる。

【0066】

アミンIIを化合物Iに変換するために使用する方法は、基Yの性質によって決まる。各Yについて、調製方法は、R³及びR⁴が同様にHである化合物IIから開始する、R³及びR⁴がHである対応する化合物Iの調製に使用する方法と同一の方法である。これらの方法は、特に、JP2009137851(Y⁴⁵)、CN1687061(Y⁵¹)、CN1597681(Y¹²)、WO04/087694(Y⁶⁵)、CN1515560(Y¹²)、CN1355164(Y⁶⁶)、CN1355163(Y⁵⁶)、CN1325849(Y¹²)、WO02/070476(Y¹)、WO02/042275(Y⁴²)、WO02/038562(Y²⁰)、WO020/24704(Y²¹)、EP1157991(Y¹²)、EP1095935(Y⁵²)、WO01/000602(Y¹³)、JP2000219679(Y¹⁷)、JP11292720(Y¹⁵)、EP902029(Y⁵⁶)、EP863142(Y¹⁹)、WO98/14452(Y⁵⁶)、WO98/07720(Y⁴²)、WO97/47626(Y¹⁴)、WO93/15074(Y¹、Y²、Y³、Y⁵)、WO94/14817(Y²¹)、WO97/28127(Y⁴⁰、Y⁴¹)、WO97/11060(Y⁴⁶)、WO97/07104(Y⁵⁵)、WO97/06150(Y⁴⁵)、WO94/05668(Y¹³)、WO96/20195(Y¹⁴)、WO96/18618(Y²¹)、WO96/02523(Y³⁷)、EP688773(Y¹³)、EP683160(Y³⁵)、JP07304759(Y³²)、WO95/22547(Y²、Y¹²、Y²⁰)、WO95/23509(Y¹³)、EP640600(Y⁶⁰)、WO92/06962(Y²)、WO93/15074(Y³)、JP06016664(Y³³)、EP568041(Y⁵⁶)、WO93/19065(Y¹³)、JP05213970(Y³⁷)、JP05140155(Y⁵⁶)、WO93/03043(Y³⁹)、WO92/21684(Y³⁷)、JP04145087(Y³⁷)、WO92/06962(Y²)、WO92/02509(Y²)、EP454444(Y⁵⁰)、EP448188(Y³⁹)、JP03081275(Y²)、EP422639(Y¹⁷)、EP415642(Y⁵⁰)、DE3922107(Y¹⁴、Y³¹)、WO90/10626(Y³¹)、EP371240(Y⁶³、Y⁶⁴)、EP334055(Y¹⁷、Y²⁰、Y³⁸)、EP349832(Y²¹)、EP338533(Y¹⁴、Y³¹)、EP328001(Y³¹)、JP01139580(Y¹¹、Y¹⁷、Y⁵⁵)、EP311135(Y¹³、Y¹⁷、Y²¹、Y³⁸、Y³⁹)、EP305923(Y²³)、US4830659(Y³⁷)、EP304935(Y¹⁷)、EP304920(Y³⁷)、JP63222167(Y¹)、WO88/05264(Y²⁰)、EP273417(Y³⁷)及びEP176101(Y³⁷)に記載されている。

【0067】

そして、ニトロ化合物IIIは対応するフェニル化合物IV：

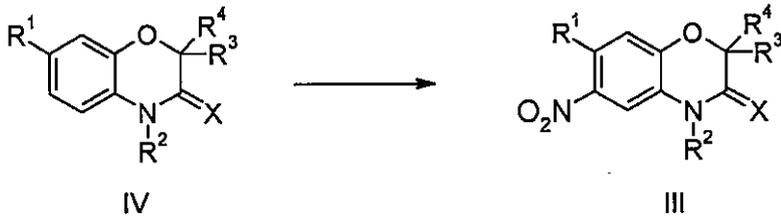
10

20

30

40

【化21】



【0068】

から得ることができる。

【0069】

フェニル化合物IVのニトロ化は、-20 ~ 100 (特に好ましくは0 ~ 20) で通常行われる(Organikum, Heidelberg, 1993, 第553~557ページ)。

【0070】

適するニトロ化剤は、好ましくは50:1~1:50、より好ましくは20:1~1:20の範囲内(非常に好ましくは10:1~1:10の範囲内)にある濃H₂SO₄と濃HNO₃の混合物である。

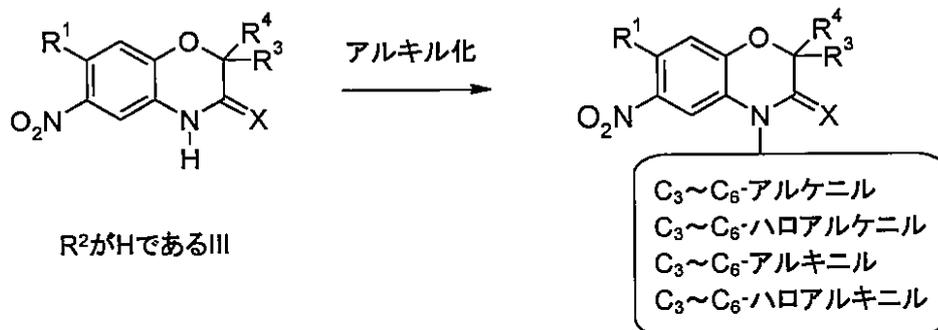
【0071】

後処理は公知の方法で行うことができる。

【0072】

R²がC₃~C₆-アルケニル、C₃~C₆-ハロアルケニル、C₃~C₆-アルキニル又はC₃~C₆-ハロアルキニル(好ましくはC₃~C₆-アルキニル)である、ニトロ化合物IIIは、R²がHである、ニトロ化合物IIIのアルキル化：

【化22】



III(式中、R²はC₃~C₆-アルケニル、
 C₃~C₆-ハロアルケニル、
 C₃~C₆-アルキニル、
 C₃~C₆-ハロアルキニルである)

【0073】

によっても調製することができる。

【0074】

この反応は、塩基の存在下にある不活性有機溶媒中-78 ~ 反応混合物の沸点(好ましくは-40 ~ 100)で通常行われる(WO02/066471)。

【0075】

適する溶媒は、脂肪族炭化水素、例えばペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン及びC₅~C₈-アルカン混合物、芳香族炭化水素、例えばトルエン、o-キシレン、m-キシレン及びp-キシレン、ハロゲン化炭化水素、例えばジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、クロロホルム及びクロロベンゼン、エーテル、例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、ジオキサン、アニソール及びテトラヒドロフラン、グリコールエーテル、例えばジメチルグリコールエーテル、ジエチルグリコールエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル、エステル、例えば酢酸エチル

10

20

30

40

50

、酢酸プロピル、イソ酪酸メチル、酢酸イソブチル、カルボキサミド、例えばN, N - ジメチルホルムアミド、N - メチルピロリドン、N, N - ジメチルアセトアミド、ニトリル、例えばアセトニトリル及びプロピオニトリル、ケトン、例えばアセトン、メチルエチルケトン、ジエチルケトン及びtert - ブチルメチルケトン、並びにジメチルスルホキシドである。特に好ましいのはエーテル、例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、tert - ブチルメチルエーテル、ジオキサン、アニソール及びテトラヒドロフランである。記載した溶媒の混合物も用いることができる。

【0076】

適する塩基は、一般的には、アルカリ金属及びアルカリ土類金属水素化物、例えば水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム及び水素化カルシウム、アルカリ金属及びアルカリ土類金属炭酸塩、例えば炭酸リチウム、炭酸カリウム及び炭酸カルシウム、並びにアルカリ金属重炭酸塩、例えば重炭酸ナトリウム、アルカリ金属及びアルカリ土類金属アルコキシド、例えばナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムエトキシド、カリウムtert - ブトキシド、カリウムtert - ペントキシド及びジメトキシマグネシウム等の無機化合物、及び、さらには、例えば三級アミン、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン及びN - メチルピペリジン、ピリジン、置換ピリジン、例えばコリジン、ルチジン、N - メチルモルホリン及び4 - ジメチルアミノピリジン並びに二環式アミン等の有機塩基である。特に好ましいのは、三級アミン、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン並びにアルカリ金属及びアルカリ土類金属アルコキシド、例えばナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムエトキシドである。

10

20

【0077】

これらの塩基は一般的には触媒量で用いられる；が、等モル量、過剰でも用いることができ、あるいは、適切であれば、溶媒としても用いることができる。

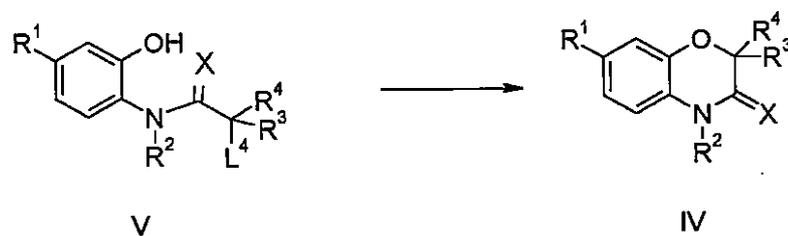
【0078】

後処理は公知の方法で行うことができる。

【0079】

そして、フェニル化合物IVは対応するアセトアミドV：

【化23】



30

【0080】

から得ることができる。

【0081】

アセトアミドVの環化は、塩基の存在下にある不活性有機溶媒中0 ~ 反応混合物の沸点（好ましくは0 ~ 140、特に好ましくは20 ~ 120）で通常行われる（WO 02/066471）。

40

【0082】

L⁴は、Cl、Br、Iから選択されるハロゲン、好ましくはCl又はBr、最も好ましくはClである（Brも最も好ましい）。

【0083】

適する溶媒は、脂肪族炭化水素、例えばペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン及びC₅ ~ C₈ - アルカン混合物、芳香族炭化水素、例えばトルエン、o - キシレン、m - キシレン及びp - キシレン、ハロゲン化炭化水素、例えばジクロロメタン、1, 2 - ジクロロエタン、クロロホルム及びクロロベンゼン、エーテル、例えばジエチルエーテル、ジイソブ

50

ロピルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、ジオキサン、アニソール及びテトラヒドロフラン、グリコールエーテル、例えばジメチルグリコールエーテル、ジエチルグリコールエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル、エステル、例えば酢酸エチル、酢酸プロピル、イソ酪酸メチル、酢酸イソブチル、カルボキサミド、例えばN,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、N,N-ジメチルアセトアミド、ニトリル、例えばアセトニトリル及びプロピオニトリル、並びにジメチルスルホキシドである。

【0084】

記載した溶媒の混合物も用いることができる。

【0085】

適する塩基は、一般的には、アルカリ金属及びアルカリ土類金属水酸化物、例えば水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム及び水酸化カルシウム、アルカリ金属及びアルカリ土類金属酸化物、例えば酸化リチウム、酸化ナトリウム、酸化カルシウム及び酸化マグネシウム、アルカリ金属及びアルカリ土類金属水素化物、例えば水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム及び水素化カルシウム、アルカリ金属及びアルカリ土類金属炭酸塩、例えば炭酸リチウム、炭酸カリウム及び炭酸カルシウム、並びにアルカリ金属重炭酸塩、例えば重炭酸ナトリウム等の無機化合物、金属有機化合物、好ましくはアルカリ金属アルキル、例えばメチルリチウム、ブチルリチウム及びフェニルリチウム、アルキルマグネシウムハロゲン化物、例えばメチルマグネシウムクロリド並びにアルカリ金属及びアルカリ土類金属アルコキシド、例えばナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシド、カリウムtert-ペン

10

20

【0086】

塩基は一般的には触媒量で用いられる、が、等モル量、過剰でも用いることができ、あるいは、適切であれば、溶媒として用いることができる。

【0087】

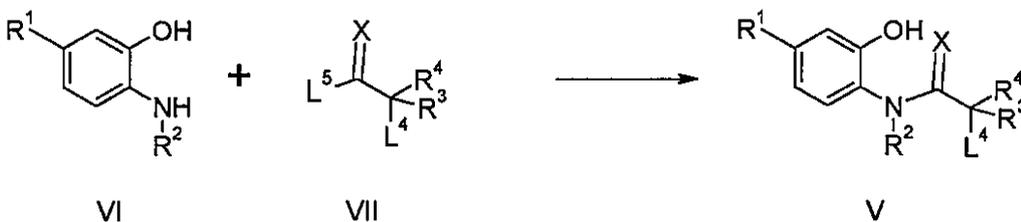
後処理は、公知の方法で行うことができる。

30

【0088】

そして、アセトアミドVは対応するフェノールVI：

【化24】



40

【0089】

から得ることができる。

【0090】

この反応は、塩基の存在下にある不活性有機溶媒中 - 78 ~ 反応混合物の沸点 (好ましくは - 40 ~ 100、特に好ましくは - 20 ~ 30) で通常行われる (WO 02/066471)。

【0091】

L⁴ は、Cl、Br、I から選択されるハロゲン、好ましくはCl又はBr、最も好ましくはClである (Brも最も好ましい)。

50

【0092】

L⁵は、公知のアシル化活性基、例えばハロゲン又はC₁～C₆-アルコキシ、好ましくはCl又はC₁～C₆-アルコキシ、最も好ましくはCl、OCH₃又はOC₂H₅である。

【0093】

適する溶媒は、脂肪族炭化水素、例えばペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン及びC₅～C₈-アルカン混合物、芳香族炭化水素、例えばトルエン、o-キシレン、m-キシレン及びp-キシレン、ハロゲン化炭化水素、例えばジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、クロロホルム及びクロロベンゼン、エーテル、例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、ジオキサン、アニソール及びテトラヒドロフラン、グリコールエーテル、例えばジメチルグリコールエーテル、ジエチルグリコールエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル、エステル、例えば酢酸エチル、酢酸プロピル、イソ酪酸メチル、酢酸イソブチル、カルボキサミド、例えばN,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、N,N-ジメチルアセトアミド、ニトリル、例えばアセトニトリル及びプロピオニトリル、ケトン、例えばアセトン、メチルエチルケトン、ジエチルケトン及びtert-ブチルメチルケトン、並びにジメチルスルホキシドである。

10

【0094】

特に好ましいのは、エーテル、例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、ジオキサン、アニソール及びテトラヒドロフランである。

20

【0095】

記載した溶媒の混合物も用いることができる。

【0096】

適する塩基は、一般的には、アルカリ金属及びアルカリ土類金属水素化物、例えば水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム及び水素化カルシウム、アルカリ金属及びアルカリ土類金属炭酸塩、例えば炭酸リチウム、炭酸カリウム及び炭酸カルシウム、並びにアルカリ金属重炭酸塩、例えば重炭酸ナトリウム、アルカリ金属及びアルカリ土類金属アルコキシド、例えばナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシド、カリウムtert-ペントキシド及びジメトキシマグネシウム等の無機化合物、及び、さらには、例えば三級アミン、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン及びN-メチルピペリジン、ピリジン、置換ピリジン、例えばコリジン、ルチジン、N-メチルモルホリン及び4-ジメチルアミノピリジン並びに二環式アミン等の有機塩基である。

30

【0097】

特に好ましいのは、三級アミン、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン並びにアルカリ金属及びアルカリ土類金属アルコキシド、例えばナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムエトキシドである。

【0098】

塩基は一般的には触媒量で用いられるが、等モル量、過剰でも用いることができ、あるいは、適切であれば、溶媒としても用いることができる。

40

【0099】

後処理は、公知の方法で行うことができる。

【0100】

アセトアミドVを調製するのに必要なフェノールVIは文献(WO02/066471)で知られており、つまりその引用文献に従うことで調製することができるし及び/又は市販もされている。

【0101】

アセトアミドVを調製するのに必要な化合物VIIは市販品として入手可能である。

【0102】

50

式 I で表されるベンゾオキサジノン及びそれらを含む組成物は除草剤として適している。これらはそれ自体としてもまた適切に製剤化された組成物としても適している。式 I で表されるベンゾオキサジノンを含む除草剤組成物は、特に高施用量で、非作物地の植物をきわめて効果的に防除する。この除草剤組成物は、コムギ、イネ、トウモロコシ、ダイズ及びワタ等の作物における広葉雑草及び雑草イネ科植物に対してその作物植物には何ら有意な損傷を引き起こすことなく作用する。この効果は低施用量で主に認められる。

【 0 1 0 3 】

当該の施用方法にもよるが、式 I で表されるベンゾオキサジノン又はそれを含む組成物は、さらに、別の種類の作物植物での望ましくない植物の防除に用いることができる。適する作物の例は、以下の通りである：

アリウム・セパ (*Allium cepa*; タマネギ)、アナナス・コモスス (*Ananas comosus*; パイナップル)、アラキス・ヒポゲア (*Arachis hypogaea*; ラッカセイ)、アスパラガス・オフィチナリス (*Asparagus officinalis*; アスパラガス)、アベナ・サチバ (*Avena sativa*; エンバク)、ベータ・ブルガリス品種アルチシマ (*Beta vulgaris spec. altissima*; テンサイ)、ベータ・ブルガリス品種ラパ (*Beta vulgaris spec. rapa*; サトウダイコン)、ブラッシカ・ナプス変種ナプス (*Brassica napus var. napus*; セイヨウアブラナ)、ブラッシカ・ナプス変種ナポブラッシカ (*Brassica napus var. napobrassica*; セイヨウキャベツ)、ブラッシカ・ラパ変種シルベストリス (*Brassica rapa var. silvestris*; インドアブラナ)、ブラッシカ・オレラセア (*Brassica oleracea*; セイヨウキャベツ)、ブラッシカ・ニグラ (*Brassica nigra*; クロガラシ)、カメリア・シネンシス (*Camellia sinensis*; チャ)、カルタムス・チンクトリウス (*Carthamus tinctorius*; ベニバナ)、カルヤ・イリノイネンシス (*Carya illinoensis*; ペカン)、シトルス・リモン (*Citrus limon*; レモン)、シトルス・シネンシス (*Citrus sinensis*; オレンジスイート)、コフェア・アラビカ (*Coffea arabica*; アラビアコーヒーノキ)、コフェア・カネフォラ (*Coffea canephora*; ロブスタコーヒーノキ)、コフェア・リベリカ (*Coffea liberica*; リベリアコーヒーノキ)、ククミス・サチバス (*Cucumis sativus*; キュウリ)、シノドン・デクチドン (*Cynodon dactylon*; ギョウギシバ)、ダウカス・カロタ (*Daucus carota*; ニンジン)、エラエイス・ギネエンシス (*Elaeis guineensis*; アブラヤシ)、フラガリア・ベスカ (*Fragaria vesca*; イチゴ)、グリシン・マクス (*Glycine max*; ダイズ)、ゴシッピーウム・ヒルスツム (*Gossypium hirsutum*; リクチワタ)、ゴシッピーウム・アルボレウム (*Gossypium arboreum*; キダチワタ)、ゴシッピーウム・ヘルバケウム (*Gossypium herbaceum*; アジアワタ)、ゴシッピーウム・ビチフォリウム (*Gossypium vitifolium*; ウミシマワタ)、ヘリアンタス・アヌウス (*Helianthus annuus*; ヒマワリ)、ヘベア・ブラシリエンシス (*Hevea brasiliensis*; パラゴムノキ)、ホルデウム・ブルガレ (*Hordeum vulgare*; オオムギ)、フムラス・ルブルス (*Humulus lupulus*; ホップ)、イポモエア・パタタス (*Ipomoea batatas*; サツマイモ)、ジュグランス・レギア (*Juglans regia*; シナノグルミ)、レンス・クリナリス (*Lens culinaris*; ヒラマメ)、リヌム・ウシタチシマム (*Linum usitatissimum*; アマ)、リコベルシコン・リコベルシカム (*Lycopersicon lycopersicum*; トマト)、マルス・品種 (*Malus spec.*; リンゴ属品種)、マニホット・エスクレンタ (*Manihot esculenta*; キャッサバ)、メジカゴ・サチバ (*Medicago sativa*; アルファルファ)、ムサ・品種 (*Musa spec.*; パナナ属品種)、ニコチアナ・タバクム (*Nicotiana tabacum*; タバコ)、ニコチアナ・ルスチカ (*Nicotiana rustica*; マルパタバコ)、オレア・エウロペア (*Olea europaea*; オリーブ)、オリザ・サチバ (*Oryza sativa*; イネ)、ファセオラス・ルナタス (*Phaseolus lunatus*; ライマメ)、ファセオラス・ブルガリス (*Phaseolus vulgaris*; インゲンマメ)、ピセア・アビエス (*Picea abies*; ドイツトウヒ)、ピナス・品種 (*Pinus spec.*; マツ属品種)、ピスタシア・ベラ (*Pistacia vera*; ピスタシオノキ)、ピスム・サチバム (*Pisum sativum*; エンドウ)、プルナス・アビウム (*Prunus avium*; セイヨウウミザクラ)、プルナス・ペルシカ (*Prunus persica*; モモ)、ピルス・コムニス (*Pyrus communis*; セイヨウナシ)、プルナス・アルメニアカ (*Prunus armeniaca*; アンズ)、プルナス・サラスス (*Prunus ceras*

10

20

30

40

50

us ; サクラ)、ブルヌス・デュルシス (*Prunus dulcis* ; アーモンド)、ブルヌス・ドメ
 スチカ (*Prunus domestica* ; プルーン)、リベス・シルベストレ (*Ribes sylvestre* ; フ
 サスグリ)、リシナス・コムニス (*Ricinus communis* ; ヒマ)、サッカラム・オフィシナ
 ルム (*Saccharum officinarum* ; サトウキビ)、セカレ・セラアレ (*Secale cereale* ; ラ
 イムギ)、シナピス・アルバ (*Sinapis alba* ; シロガラシ)、ソラナム・ツベロサム (*Solanum tuberosum* ; ジャガイモ)、ソルガム・ビコロル (*Sorghum bicolor* ; モロコシ) (*Sorghum vulgare* ; ホウキモロコシ)、テオブロマ・カカオ (*Theobroma cacao* ; カカオ)、トリフォリウム・プラテンセ (*Trifolium pratense* ; アカツメクサ)、トリチウム・アエスチバム (*Triticum aestivum* ; コムギ)、トリチカレ (*Triticale* ; ライコムギ)、トリチウム・デュラム (*Triticum durum* ; マカロニコムギ)、ピ
 シア・ファバ (*Vicia faba* ; ソラマメ)、ピティス・ビニフェラ (*Vitis vinifera* ; ブドウ)、及びゼア・マイル (*Zea mays* ; トウモロコシ)

10

好ましい作物は、以下の通りである：アラキス・ヒポゲア (*Arachis hypogaea* ; ラッカ
 セイ)、ベータ・ブルガリス品種アルチシマ (*Beta vulgaris spec. altissima* ; テンサイ)、ブラシカ・ナプス変種ナプス (*Brassica napus var. napus* ; セイヨウアブラナ)、ブラシカ・オレラセア (*Brassica oleracea* ; セイヨウキャベツ)、シトルス・リ
 モン (*Citrus limon* ; レモン)、シトルス・シネンシス (*Citrus sinensis* ; オレンジス
 ウィート)、コフェア・アラビカ (*Coffea arabica* ; アラビアコーヒーノキ) (*Coffea*
 ・カネフォラ (*Coffea canephora* ; ロブスタコーヒーノキ)、*Coffea liberica* ; リベリア
 コーヒーノキ)、シノドン・デクチドン (*Cynodon dactylon* ; ギョウギシバ)、グリシン・マクス (*Glycine max* ; ダイズ)、ゴシッピウム・ヒルスツ
 ム (*Gossypium hirsutum* ; リクチワタ) (*Gossypium arboreum* ; キダチワタ)、*Gossypium herbaceum* ; アジアワタ)、*Gossypium vitifolium* ; ウミシマワタ)、ヘリアンタス
 ・アヌウス (*Helianthus annuus* ; ヒマワリ)、ホルデウム・ブルガレ (*Hordeum vulgare* ; オオムギ)、ジュグランス・レギア (*Juglans regia* ; シナノグルミ)、レンス・クリ
 ナリス (*Lens culinaris* ; ヒラマメ)、リナム・ウシタチシマム (*Linum usitatissimum* ; アマ)、リコペルシコン・リコペルシカム (*Lycopersicon lycopersicum* ; トマト)、
 マルス・品種 (*Malus spec.* ; リンゴ属品種)、メジカゴ・サチバ (*Medicago sativa* ; ア
 ルファルファ)、ニコチアナ・タバカム (*Nicotiana tabacum* ; タバコ) (*Nicotiana rustica* ; マルパタバコ)、オレア・エウロペア (*Olea europaea* ; オリーブ)、オリザ・サチバ (*Oryza sativa* ; イネ)、ファセオラス・ルナタス (*Phaseolus lunatus* ; ライマメ)、ファセオラス・ブルガリス (*Phaseolus vulgaris* ; インゲンマメ)、ピスタシア・ベラ (*Pistacia vera* ; ピスタシオノキ)、ピスム・サチバム (*Pisum sativum* ; エンドウ)、ブルヌス・デュルシス (*Prunus dulcis* ; アーモンド)、サ
 ッカラム・オフィシナルム (*Saccharum officinarum* ; サトウキビ)、セカレ・セラアレ
 (*Secale cereale* ; ライムギ)、ソラナム・ツベロサム (*Solanum tuberosum* ; ジャガイ
 モ)、ソルガム・ビコロル (*Sorghum bicolor* ; モロコシ) (*Sorghum vulgare* ; ホウキモロコシ)、トリチカレ (*Triticale* ; ライコムギ)、トリチウム
 ・デュラム (*Triticum durum* ; マカロニコムギ)、ピシア・ファバ (*Vicia faba* ; ソラマ
 メ)、ピティス・ビニフェラ (*Vitis vinifera* ; ブドウ)、及びゼア・マイル (*Zea mays* ; トウモロコシ)。

20

30

40

【 0 1 0 4 】

本発明による式 I のベンゾオキサジノンは遺伝子修飾植物にも用いることができる。用語「遺伝子修飾植物」は、自然状況下の交雑育種、突然変異又は自然組み換えでは容易に得ることができないように組み換え DNA 手法を用いることによって遺伝物質が修飾されている、植物と理解する。典型的には、植物の一部の特性を改良するために 1 つ又はそれ以上の遺伝子が遺伝子修飾植物の遺伝物質に組み込まれている。そのような遺伝子修飾には、限定するものではないが、例えばグリコシル化あるいはポリマー付加、例えばプレニル化、アセチル化又はファルネシル化部分構造あるいは P E G 部分構造によるタンパク質

50

、オリゴ - ペプチド又はポリ - ペプチドの標的化翻訳後修飾も限定するものではないが包含される。品種改良、突然変異あるいは遺伝子工学によって修飾されている植物は、通常の品種改良法又は遺伝子工学の結果として、例えば、ある種の除草剤の群、例えばヒドロキシフェニルピルパートジオキシゲナーゼ (HPPD) 阻害物質；アセトラクタートシターゼ (ALS) 阻害物質、例えばスルホニル尿素 (例えばUS 6, 222, 100, WO 01/82685、WO 00/26390、WO 97/41218、WO 98/02526、WO 98/02527、WO 04/106529、WO 05/20673、WO 03/14357、WO 03/13225、WO 03/14356、WO 04/16073を参照されたい) 又はイミダゾリノン (例えばUS 6, 222, 100, WO 01/82685、WO 00/026390、WO 97/41218、WO 98/002526、WO 98/02527、WO 04/106529、WO 05/20673、WO 03/014357、WO 03/13225、WO 03/14356、WO 04/16073を参照されたい)；エノルピルピルシキマー3 - ホスファートシターゼ (EPSPS) 阻害物質、例えば、グリホセート (例えばWO 92/00377を参照されたい)；グルタミンシターゼ (GS) 阻害物質、例えばグルホシネート (例えばEP - A 242236、EP - A 242246を参照されたい) 又はオキシニル系除草剤 (例えばUS 5, 559, 024を参照されたい)；の施用に対して耐性であるようにされている。いくつかの栽培植物が通常の品種改良法 (突然変異) により除草剤に対して耐性であるようにされており、例えばClearfield (登録商標) サマーレイブ (夏アブラナ) (Canola, BASF SE, ドイツ) はイミダゾリノン (例えばイマザモックス) に対して耐性である。遺伝子工学法を用いて栽培植物、例えばダイズ、ワタ、トウモロコシ、サトウダイコンやレイブが除草剤、例えばグリホセートやグルホシネートに対して耐性であるようにされており、一部のものは商品名Roundup Ready (登録商標) (グリホセート耐性、Monsanto, 米国) 及びLiberty Link (登録商標) (グルホシネート耐性、Bayer Crop Science, ドイツ) で市販品として入手可能である。

【0105】

さらに、組み換えDNA手法を用いることで、1種又はそれ以上の殺昆虫タンパク質、特に細菌バチルス属 (特にバチルス・ツリングエンシス) からのものと知られている殺昆虫タンパク質、例えば、エンドトキシン (例えばCry IA (b)、Cry IA (c)、Cry IF、Cry IF (a2)、Cry - IIA (b)、Cry IIIA、Cry IIB (b1) 又はCry 9c)；栄養成長期殺昆虫タンパク質 (VIP)、例えば、VIP 1、VIP 2、VIP 3 又はVIP 3A；細菌コロニー形成性線虫 (例えばホトルハブダス種 (Photorhabdus spp.) やゼノルハブダス種 (Xenorhabdus spp.)) の殺昆虫タンパク質；動物によって産生されるトキシン、例えば、サソリトキシン、クモ形類動物トキシン、ハチトキシン、又は他の昆虫特異的ニューロトキシン；真菌によって産生されるトキシン (例えばストレプトミセテス・トキシン)、植物レクチン (例えばエンドウ又はオオムギレクチン)；アグルチニン；プロテインナーゼ阻害剤、例えばトリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン阻害剤、シスタチン阻害剤やパパイン阻害剤；リボソーム - 不活化タンパク質 (RIP)、例えば、リシン (ricin)、トウモロコシ - RIP、アプリン、ルフィン、サポリンやブリヨジン；ステロイド代謝酵素、例えば、3 - ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド - IDP - グリコシル - トランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン阻害剤やHMG - CoA - レダクターゼ；イオンチャネルブロッカー、例えばナトリウム又はカルシウムチャネルブロッカー；幼若ホルモンエステラーゼ；利尿ホルモン受容体 (ヘリコキニン受容体)；スチルベンシターゼ、ピベンジルシターゼ、キチナーゼ又はグルカナナーゼ；を合成することができる植物も包含される。本発明の文脈では、これらの殺昆虫タンパク質つまりトキシンは、明らかに、プレトキシン、ハイブリッドタンパク質、トランケーテッドタンパク質又はそうでなければ修飾タンパク質としても理解されるべきである。ハイブリッドタンパク質は、タンパク質ドメインの新規な組み合わせを特徴としている (例えばWO 02/0

10

20

30

40

50

15701を参照されたい)。このようなトキシン又はこのようなトキシンを合成することができる遺伝子修飾植物の別の例は、例えば、EP-A374753、WO93/007278、WO95/34656、EP-A427529、EP-A451878、WO03/018810、及びWO03/052073に開示されている。そのような遺伝子修飾植物の作製方法は当業者には一般的に知られており、例えば、先に言及した文献に記載されている。遺伝子修飾植物中に含有のこれら殺昆虫タンパク質は、そのようなタンパク質を産生している植物に、節足動物昆虫のあらゆる分類学上の群に属する有害害虫、特にカブトムシ(鞘翅目(Coleoptera))、二翼昆虫(双翅目(Diptera))、及び蛾(鱗翅目(Lepidoptera))に対する耐性、及び、センチュウ(線虫綱動物(Nematoda))に対する耐性を賦与する。1種又はそれ以上の殺昆虫タンパク質を合成することができる遺伝子修飾植物は、例えば、先に言及した文献に記載されており、またそれらのうちの一部のものは市販もされており、例えば、Yield Gard(登録商標)(Cry1Abトキシンを産生するトウモロコシ栽培変種)、Yield Gard(登録商標)Plus(Cry1Ab及びCry3Bb1トキシンを産生するトウモロコシ栽培変種)、Starlink(登録商標)(Cry9cトキシンを産生するトウモロコシ栽培変種)、Herculex(登録商標)RW(Cry34Ab1、Cry35Ab1及び酵素ホスフィノトリシン-N-アセチルトランスフェラーゼ(PAT)を産生するトウモロコシ栽培変種);NuCOTN(登録商標)33B(Cry1Actトキシンを産生するワタ栽培変種)、Bollgard(登録商標)I(Cry1Actトキシンを産生するワタ栽培変種)、Bollgard(登録商標)II(Cry1Actトキシン及びCry2Ab2トキシンを産生するワタ栽培変種);VIPCOT(登録商標)(VIPトキシンを産生するワタ栽培変種);NewLeaf(登録商標)(Cry3Atトキシンを産生するジャガイモ栽培変種);Syngenta Seeds SAS(仏)から販売のBt-Xtra(登録商標)、NatureGard(登録商標)、KnockOut(登録商標)、BiteGard(登録商標)、Protecta(登録商標)、Bt11(例えばAgrisure(登録商標)CB)及びBt176(Cry1Abトキシン及びPAT酵素を産生するトウモロコシ栽培変種)、Syngenta Seeds SAS(仏)から販売のMIR604(Cry3Atトキシンの修飾体を産生するトウモロコシ栽培変種、WO03/018810を参照されたい)、Monsanto Europe S.A.(ベルギー)から販売のMON 863(Cry3Bb1トキシンを産生するトウモロコシ栽培変種)、Monsanto Europe S.A.(ベルギー)から販売のIPC 531(Cry1Actトキシンの修飾体を産生するワタ栽培変種)、及びPioneer Overseas Corporation(ベルギー)から販売の1507(Cry1Fトキシン及びPAT酵素を産生するトウモロコシ栽培変種)等である。

【0106】

さらに、組み換えDNA手法を用いることによって、細菌性、ウイルス性又は真菌性病原体に対する植物の抵抗又は耐性を増大させるための1種又はそれ以上のタンパク質を合成することができる植物も包含される。そのようなタンパク質の例は、いわゆる「感染特異的タンパク質」(PRタンパク質、例えばEP-A0392225を参照されたい)、植物病害耐性遺伝子(例えば、メキシコ産野生種ジャガイモソラヌム・ブルボカスタヌム(Solanum bulbocastanum)から誘導された、ファイトフトラ・インフェスタンス(Phytophthora infestans)に対して作用する抵抗遺伝子を発現しているジャガイモ栽培変種)あるいはT4-lysozyme(例えば、エルビニア・アミロボラ(Erwinia amylovora)等の細菌に対する抵抗が増大されるようなタンパク質を合成することができるジャガイモ栽培変種)である。そのような遺伝子修飾植物の作製方法は一般的には当業者に知られており、例えば、先に言及した文献に述べられている。

【0107】

さらに、組み換えDNA手法を用いることによって、植物の生産性(例えばバイオマス生産、穀粒収量、デンプン含有量、油分含有量やタンパク質含有量);日照り、塩害や他

10

20

30

40

50

の生長制限環境因子に対する植物の耐性；あるいは害虫や真菌、細菌又はウイルス病原体に対する植物の耐性；を増大させる1種又はそれ以上のタンパク質を合成することができる植物も包含される。

【0108】

さらに、組み換えDNA手法を用いることによって、ヒト又は動物の栄養摂取を特異的に改善するために、改変された量の物質含有量又は新規物質の含有量を含む植物、例えば健康促進長鎖オメガ-3脂肪酸又は不飽和オメガ-9脂肪酸を産生する油作物（例えばNexera（登録商標）アブラナ、DOW Agro Sciences, カナダ）も包含される。

【0109】

さらに、組み換えDNA手法を用いることによって、原材料産生を特異的に改善するために、改変された量の物質含有量又は新規物質含有量を含む植物、例えばアミロペクチンの産生量が増大されたジャガイモ（例えばAmflora（登録商標）potato、BASFE, ドイツ）も包含される。

【0110】

本発明による式Iのベンゾオキサジノンは、遺伝子工学又は品種改良によって1種又はそれ以上の除草剤に対して抵抗性である作物植物、遺伝子工学又は品種改良によって植物病原性真菌等の1種又はそれ以上の病原体に対して抵抗性である作物植物、あるいは遺伝子工学又は品種改良によって昆虫による攻撃に対して抵抗性である作物植物にも用いることができる。

【0111】

適しているのは、例えば、除草剤PPO阻害物質に抵抗性である作物植物（好ましくはトウモロコシ、コムギ、ヒマワリ、サトウキビ、ワタ、イネ、カノラ、アブラナ又はダイズ）や、遺伝子修飾によるBtトキシシン遺伝子導入によって、ある種の昆虫からの攻撃に抵抗性である作物植物である。

【0112】

さらに、式Iで表されるベンゾオキサジノンは植物部分の落葉化及び/又は乾燥化にも適していることが見出されており、これにはワタ、ジャガイモ、ナタネ、ヒマワリ、ダイズ又はソラマメ等の作物植物（特にはワタ）が適している。この関連で、植物を落葉化及び/又は乾燥化させるための組成物、そのような組成物を調製するための方法、及び式Iのベンゾオキサジノンをを用いた植物の落葉化及び/又は乾燥化方法が見出されている。

【0113】

乾燥化剤としては、式Iのベンゾオキサジノンは、ジャガイモ、ナタネ、ヒマワリ及びダイズ等の作物植物以外に、穀草の地上部分を乾燥化させるのにも特に適している。このことは、この重要な植物の完全機械収穫を可能にするものである。

【0114】

また、経済利益があるのが、柑橘類果実、オリーブ及び他の種さらにはさまざまな高価果実、石果及び堅果の裂開を一定の時間期間内に集中させることによって、つまり、木に付着しているのを減らすことによって可能になる収穫促進である。この同じ機序、すなわち植物の果実部分又は葉部分と枝部分との間の脱落組織の発達促進は、有用植物（特にはワタ）の落葉化管理にも必須である。

【0115】

さらには、個々のワタの木が成熟する期間間隔の短縮は、収穫後の繊維品質の向上をもたらす。

【0116】

式Iのベンゾオキサジノン（又は式Iのベンゾオキサジノンを含む除草剤組成物）は、例えば、そのまま噴霧できる水性溶液剤、粉剤、懸濁液剤、さらには高濃度水性、油性若しくは他の懸濁液剤つまりディスパージョン、エマルジョン、油ディスパージョン、ペースト、粉末、広域散布剤、あるいは顆粒剤の形態で、噴霧、霧化、散粉、散布、注液又は種子処理つまり種子との混合で用いることができる。使用剤形は、意図する目的によって

10

20

30

40

50

決まるが、いずれのケースにおいても、本発明による活性成分の可能な限りの微細な分散を確実なものにするものであるべきである。

【0117】

この除草剤組成物は、式Iで表される少なくとも1種のベンゾオキサジノンの除草活性量、及び、作物保護剤の製剤化で慣用の助剤を含んでいる。

【0118】

作物保護剤の製剤化で慣用の助剤の例は、不活性助剤、固体担体、界面活性剤（例えば分散剤、保護コロイド、乳化剤、湿潤剤及び粘着付与剤）、有機並びに無機増粘剤、静菌剤、凍結防止剤、消泡剤、場合による着色剤、及び、種子処理用の、結着剤である。

【0119】

当業者ならそのような製剤化の処方を十分熟知しているものである。

【0120】

増粘剤（すなわち、製剤に改変された流動特性、すなわち静止の状態では高粘度、及び、運動の状態では低粘度を賦与する化合物）の例は、多糖類（例えばキサンタンガム（Kelcoから販売のKelzan（登録商標））、Rhodopol（登録商標）23（Rhône-Poulenc）又はVeegum（登録商標）（R.T.Vanderbiltから販売））及び有機並びに無機板状原材料（例えばAttaclay（登録商標）（Engelhardから販売））である。

【0121】

消泡剤の例は、シリコンエマルジョン（例えば、Silikon（登録商標）SRE（Wacker）又はRhodiaから販売のRhodorsil（登録商標））、長鎖アルコール、脂肪酸、脂肪酸の塩、有機フッ素化合物並びにこれらの混合物である。

【0122】

静菌剤は、除草水性製剤を安定化させるのに加えられ得る。静菌剤の例は、ジクロロフェン及びベンジルアルコールヘミホルマルをベースとする静菌剤（ICIから販売のProxel（登録商標）又はThor-Chemieから販売のActicide（登録商標）RS及びRohm & Haasから販売のKathon（登録商標）MK）並びにイソチアゾリノン誘導体（例えばアルキルイソチアゾリノン及びベンゾイソチアゾリノン）をベースとする静菌剤（Thor-Chemieから販売のActicide（登録商標）MBS）である。

【0123】

凍結防止剤の例は、エチレングリコール、プロピレングリコール、尿素やグリセロールである。

【0124】

着色剤の例は、水僅少可溶顔料（ピグメント）と水可溶染料である。言及され得る例は、ローダミンB、C.I.ピグメントレッド112及びC.I.ソルベントレッド1の名称で知られる染料、並びにピグメントブルー15：4、ピグメントブルー15：3、ピグメントブルー15：2、ピグメントブルー15：1、ピグメントブルー80、ピグメントイエロー1、ピグメントイエロー13、ピグメントレッド112、ピグメントレッド48：2、ピグメントレッド48：1、ピグメントレッド57：1、ピグメントレッド53：1、ピグメントオレンジ43、ピグメントオレンジ34、ピグメントオレンジ5、ピグメントグリーン36、ピグメントグリーン7、ピグメントホワイト6、ピグメントブラウン25、ベイシックバイオレット10、ベイシックバイオレット49、アシッドレッド51、アシッドレッド52、アシッドレッド14、アシッドブルー9、アシッドイエロー23、ベイシックレッド10、ベイシックレッド108である。

【0125】

結着剤の例は、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアセタート、ポリビニルアルコール及びチローゼである。

【0126】

適する不活性助剤は、例えば、以下：中～高沸点の鉱油留分（例えばケロシン及びディ

10

20

30

40

50

ーゼルオイル並びにコールタールオイル)及び植物又は動物由来の油、脂肪族、環状及び芳香族炭化水素(例えばパラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化ナフタレン及びその誘導体、アルキル化ベンゼン及びその誘導体)、アルコール、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール及びシクロヘキサノール、ケトン、例えばシクロヘキサノンや、強極性溶媒(例えばN-メチルピロリドンのようなアミン)さらには水である。

【0127】

適する担体としては液体及び固体の担体が挙げられる。液体担体としては、例えば非水性溶媒、例えば環状及び芳香族炭化水素(例えばパラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化ナフタレン及びその誘導体、アルキル化ベンゼン及びその誘導体)、アルコール、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール及びシクロヘキサノール、ケトン、例えばシクロヘキサノン、強極性溶媒(例えばN-メチルピロリドンのようなアミン)、さらには水並びにこれらの混合物が挙げられる。

10

【0128】

固体担体としては、例えば、鉱物質土類、例えばシリカ、シリカゲル、シリケート、タルク、カオリン、石灰石、石灰、チョーク、ボール、黄土、クレイ、ドロマイト、珪藻土、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム及び酸化マグネシウム、粉碎合成原材料、肥料、例えば硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム及び尿素、さらには栽培植物起源の産物、例えば禾穀類挽き粉、樹皮挽き粉、木材挽き粉及び堅果殻引き粉、セルロース粉末、あるいは他の固体担体が挙げられる。

20

【0129】

適する界面活性剤(補佐剤、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤さらには乳化剤)は、芳香族スルホン酸、例えばリグノスルホン酸(例えばBorrespersタイプ、Borreguard)、フェノールスルホン酸、ナフタレンスルホン酸(Morwetタイプ、Akzo Nobel)及びジブチルナフタレンスルホン酸(Nekalタイプ、BASFA G)の、さらには脂肪酸の、アルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩及びアンモニウム塩;アルキルスルホナート及びアルキルアリアルスルホナート、アルキルスルファート、ラウリルエーテルスルファート及び脂肪アルコールスルファート、さらには硫酸化ヘキサ-、ヘプタ-及びオクタ-デカノールの、さらには脂肪アルコールグリコールエーテルの塩、スルホン化ナフタレン及びその誘導体とホルムアルデヒドの縮合物、ナフタレン又はナフタレンスルホン酸とフェノール及びホルムアルデヒドの縮合物、ポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテル、エトキシル化イソオクチルフェノール、エトキシル化オクチルフェノール又はエトキシル化ノニルフェノール、アルキルフェニル若しくはトリブチルフェニルポリグリコールエーテル、アルキルアリアルポリエーテルアルコール、イソトリデシルアルコール、脂肪アルコール/エチレンオキシド縮合物、エトキシル化ひまし油、ポリオキシエチレンアルキルエーテル又はポリオキシプロピレンアルキルエーテル、ラウリルアルコールポリグリコールエーテルアセタート、ソルビトールエステル、リグノ亜硫酸塩廃液並びに蛋白、変性蛋白、多糖類(例えばメチルセルロース)、疎水変性スターチ、ポリビニルアルコール(MowiolタイプClariant)、ポリカルボキシラート(BASF SE、Sokalantタイプ)、ポリアルコキシラート、ポリビニルアミン(BASF SE、Lupamineタイプ)、ポリエチレンイミン(BASF SE、Lupasolタイプ)、ポリビニルピロリドン及びそのコポリマーである。

30

40

【0130】

粉剤、広域散布剤及び粉末剤は、活性成分を固体担体と一緒にして混合又は同時粉碎することによって調製され得る。

【0131】

顆粒剤、例えば被覆顆粒剤、含浸顆粒剤及び均質顆粒剤は、活性成分を固体担体に結着させることによって調製され得る。

【0132】

水性使用剤形は、エマルジョン製剤、懸濁製剤、ペースト剤、水和性粉粒又は水分散性

50

顆粒から、水を加えることによって調製され得る。

【0133】

エマルション、ペースト又は油性ディスパーションを調製するためには、式Iのベンゾオキサジノンは、そのままか又はオイル又は溶媒に溶解させて、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤又は乳化剤を用いることによって、水にホモジナイズされ得る。別法として、活性化合物、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤又は乳化剤さらには望ましい場合は溶媒又はオイルを含む製剤を調製することも可能であり、これは水で希釈するのに適している。

【0134】

そのまま使用できる調製物(製剤)中の式Iで表されるベンゾオキサジノンの濃度は広い範囲内で変えられ得る。一般的には、製剤は、およそ0.001~98重量%、好ましくは0.01~95重量%の少なくとも1種の活性成分を含んでいる。活性成分は、90%~100%、好ましくは95%~100%の純度(NMRスペクトルによる)のものが用いられる。

10

【0135】

本発明による式Iで表されるベンゾオキサジノンの製剤中では活性成分(例えば式Iのベンゾオキサジノン)は懸濁、乳化又は溶解形態で存在している。本発明による製剤は、水性溶液、粉粒、懸濁液、さらには高濃度水性、油性又は他の懸濁液つまりディスパーション、水性エマルション、水性マイクロエマルション、水性懸濁エマルション、油ディスパーション、ペースト、粉末、散布用原材料あるいは顆粒の形態にあり得る。

20

【0136】

本発明による式Iのベンゾオキサジノンは、例えば、以下の通りに製剤化され得る。

【0137】

1. 水で希釈する調製品

A 液剤(Water-soluble concentrates)

10重量部の活性化合物を90重量部の水又は水可溶溶媒に溶解させる。別法として、湿潤剤又は他の補佐剤を加える。活性化合物は水で希釈すると同時に溶解する。これにより活性化合物含有量が10重量%の製剤が得られる。

【0138】

B 分散製剤(Dispersible concentrates)

20重量部の活性化合物を10重量部の分散剤(例えばポリビニルピロリドン)を加えてある70重量部のシクロヘキサノンに溶解させる。水で希釈すると同時にディスパーションが得られる。活性化合物含有量は20重量%である。

30

【0139】

C 乳剤(Emulsifiable concentrates)

15重量部の活性化合物をドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムとヒマシ油エトキシラートを加えてある(各場合5重量部)75重量部の有機溶媒(例えばアルキル芳香族)に溶解させる。水で希釈するとエマルションが得られる。この製剤は15重量%の活性化合物含有量を有している。

【0140】

D エマルション製剤(Emulsions)

25重量部の活性化合物をドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムとヒマシ油エトキシラートを加えてある(各場合5重量部)35重量部の有機溶媒(例えばアルキル芳香族)に溶解させる。この混合物を乳化装置(例えばUltra Turrax)を用いて30重量部の水に導入して均質なエマルションにする。水で希釈するとエマルションが得られる。この製剤は25重量%の活性化合物含有量を有している。

40

【0141】

E 懸濁製剤(Suspensions)

攪拌下にあるボールミル中で、20重量部の活性化合物を10重量部の分散剤+湿潤剤及び70重量部の水又は有機溶媒を加えて粉碎して微細活性化合物懸濁液を得る。水で希釈すると活性化合物の安定懸濁液が得られる。製剤中の活性化合物含有量は20重量%で

50

ある。

【 0 1 4 2 】

F 顆粒水和剤及び顆粒水溶剤(Water-dispersible granules及びwater-soluble granules)

専用の装置(例えば押出機、噴霧塔、流動床)を用いて50重量部の活性化合物を50重量部の分散剤+湿潤剤を加えて細かく粉碎して顆粒水和剤又は顆粒水溶剤にする。水で希釈すると活性化合物の安定なディスパージョン又は溶液が得られる。この製剤は50重量%の活性化合物含有量を有している。

【 0 1 4 3 】

G 水和剤及び水溶剤(Water-dispersible powders及びwater-soluble powders)

10

75重量部の活性化合物をローター・ステーター・ミル中で25重量部の分散剤+湿潤剤+シリカゲルを加えて粉碎する。水で希釈すると活性化合物の安定なディスパージョン又は溶液が得られる。この製剤の活性化合物含有量は75重量%である。

【 0 1 4 4 】

H ゲル剤(Gel formulations)

ボールミル中で、20重量部の活性化合物、10重量部の分散剤、1重量部のゲル化剤及び70重量部の水又は有機溶媒を混合して微細懸濁液を得る。水で希釈すると活性化合物含有量が20重量%の安定な懸濁液が得られる。

【 0 1 4 5 】

2. 希釈せずに施用する調製品

20

I 粉末剤(Dusts)

5重量部の活性化合物を細かく粉碎して95重量部の微粉碎カオリンと緊密に混合する。これにより活性化合物含有量が5重量%の散粉用粉粒が得られる。

【 0 1 4 6 】

J 顆粒剤(Granules)(GR、FG、GG、MG)

0.5重量部の活性化合物を細かく粉碎して99.5重量部の担体と組み合わせる。この場合の現代流方法は、押出、噴霧乾燥又は流動床である。これにより活性化合物含有量が0.5重量%の希釈せずに施用される顆粒剤が得られる。

【 0 1 4 7 】

K ULV溶液剤(ULV solutions)(UL)

30

10重量部の活性化合物を90重量部の有機溶媒(例えばキシレン)に溶解させる。これにより活性化合物含有量が10重量%の希釈せずに施用される調製品が得られる。

【 0 1 4 8 】

水性使用剤形は、水を加えることによってエマルジョン製剤、懸濁剤、ペースト剤、水和粉粒剤又は顆粒水和剤から調製され得る。

【 0 1 4 9 】

式Iのベンゾオキサジノン又はそれを含んでなる除草剤組成物は、発芽前、発芽後又は植物になる前に、あるいは作物植物の種子と一緒に施用され得る。作物植物の、除草剤組成物又は活性化合物で前処理された種子を施用することによっても除草剤組成物又は活性化合物は施用され得る。一部の作物植物の活性成分耐性があまり良くない場合は、噴霧装置を活用して、その感受性作物植物の葉と接触しないようできるだけ離して、同時にその下に生長している望ましくない植物の葉(又はその裸の土壌表面)に届くよう除草剤組成物を噴霧する施用方法が用いられ得る(後期実行(post-directed)、回避散布(lay-by))。

40

【 0 1 5 0 】

別の実施形態では、式Iのベンゾオキサジノン又はその除草剤組成物は、種子処理で施用され得る。この種子の処理は、基本的には、本発明による式Iのベンゾオキサジノン又はそれから調製される組成物を基に踏まえた当業者には周知のあらゆる手順(種子ドレッシング、種子コーティング、種子ダスティング、種子ソーキング、種子フィルムコーティング、種子多層コーティング、種子エンクラスティング、種子ディッピング及び種子ペレットティング)を含むものである。種子処理では、除草剤組成物は、希釈して、又は希釈せ

50

ずに、施用され得る。

【0151】

用語「種子」には、例えば、トウモロコシ、種子、果実、塊茎、苗木及び類似形態等の、あらゆるタイプの種子が含まれる。種子処理では、好ましくは、用語「種子」は、トウモロコシ及び種子を意味する。用いる種子は、先に言及した有用植物の種子であり得るが、遺伝子導入植物又は通常の品種改良法によって得られる植物の種子であっても良い。

【0152】

本発明による式 I で表されるこの活性ベンゾオキサジノンの施用の量（ベンゾオキサジノン I の全量）は、防除標的、季節、標的植物及び生長段階にもよるが、 $0.1 \text{ g/h a} \sim 3000 \text{ g/h a}$ （好ましくは $10 \text{ g/h a} \sim 1000 \text{ g/h a}$ ）の活性物質（a.s.）である。

10

【0153】

本発明のもう一つの好ましい実施形態では、式 I のベンゾオキサジノンの施用量は、 $0.1 \text{ g/h a} \sim 5000 \text{ g/h a}$ 、好ましくは $1 \text{ g/h a} \sim 2500 \text{ g/h a}$ 又は $5 \text{ g/h a} \sim 2000 \text{ g/h a}$ の活性物質（a.s.）である。

【0154】

本発明のもう一つの好ましい実施形態では、式 I のベンゾオキサジノンの施用量は、 $0.1 \sim 1000 \text{ g/h a}$ 、好ましくは $1 \sim 750 \text{ g/h a}$ 、より好ましくは $5 \sim 500 \text{ g/h a}$ の活性物質である。

【0155】

種子処理には、式 I のベンゾオキサジノンは、一般的には、 100 kg の種子あたり $0.001 \sim 10 \text{ kg}$ の量で用いられる。

20

【0156】

活性のスペクトルを広げるため、また、相乗効果を達成するため、式 I のベンゾオキサジノンは、多くの代表的な他の除草又は生長調節活性成分群と混合されてから随伴的に施用され得る。混合に適する成分は、例えば、1, 2, 4 - チアジアゾール、1, 3, 4 - チアジアゾール、アミド、アミノリン酸及びその誘導体、アミノトリアゾール、アニリド、（ヘト）アリアルオキシアルカン酸及びその誘導体、安息香酸及びその誘導体、ベンゾチアジアジノン、2 - アロイル - 1, 3 - シクロヘキサジジオン、2 - ヘタロイル - 1, 3 - シクロヘキサジジオン、ヘタリアルアリアルケトン、ベンジルイソオキサゾリジノン、メタ - CF_3 - フェニル誘導体、カルバマート、キノリンカルボン酸及びその誘導体、クロロアセトアニリド、シクロヘキサセノンオキシムエーテル誘導体、ジアジン、ジクロロプロピオン酸及びその誘導体、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロフラン - 3 - オン、ジニトロアニリン、ジニトロフェノール、ジフェニルエーテル、ジピリジル、ハロカルボン酸及びその誘導体、尿素、3 - フェニルベンゾオキサジノン、イミダゾール、イミダゾリノン、N - フェニル - 3, 4, 5, 6 - ベンゾオキサジノン、オキサジアゾール、オキシラン、フェノール、アリアルオキシフェノキシプロピオン酸エステル、ヘテロアリアルオキシフェノキシプロピオン酸エステル、フェニル酢酸及びその誘導体、2 - フェニルプロピオン酸及びその誘導体、ピラゾール、フェニルピラゾール、ピリダジン、ピリジンカルボン酸及びその誘導体、ピリミジルエーテル、スルホンアミド、スルホニル尿素、トリアジン、トリアジノン、トリアゾリノン、トリアゾールカルボキサミド、ベンゾオキサジノン、フェニルピラゾリン並びにイソオキサゾリン及びその誘導体である。

30

40

【0157】

式 I のベンゾオキサジノンを単独で又は他の除草剤との組み合わせで、又はそうでなければ他の作物保護剤との混合物の形態で（例えば害虫又は植物病原性真菌若しくは細菌の防除剤と一緒に）施用するのが有効であり得る。

【0158】

また、栄養不足や微量元素不足を処置するのに用いられる無機塩溶液との混和性も有益なところである。植物非有害性油や油性製剤等の他の添加剤も加えられ得る。

【0159】

50

別の除草活性成分 B は、除草剤の群 b 1) ~ b 1 5) から好ましくは選択される :

- b 1) 脂質生合成阻害剤 ;
- b 2) アセトラクターシンターゼ阻害剤 (A L S 阻害剤) ;
- b 3) 光合成阻害剤 ;
- b 4) プロトポルフィリノゲン - I X オキシダーゼ阻害剤 ;
- b 5) 白化除草剤 ;
- b 6) エノルピルピルシキマート 3 - ホスファートシンターゼ阻害剤 (E P S P 阻害剤) ;
- b 7) グルタミンシンターゼ阻害剤 ;
- b 8) 7 , 8 - ジヒドロプテロアートシンターゼ阻害剤 (D H P 阻害剤) ;
- b 9) 有糸分裂阻害剤 ;
- b 1 0) 極長鎖脂肪酸合成阻害剤 (V L C F A 阻害剤) ;
- b 1 1) セルロース生合成阻害剤 ;
- b 1 2) デカップラー型除草剤 ;
- b 1 3) オーキシン型除草剤 ;
- b 1 4) オーキシン輸送阻害剤 ; 及び
- b 1 5) プロモブチド、クロルフルレノール、クロルフルレノール - メチル、シンメチリン、クミルウロン、ダラボン、ダゾメト、ジフェンゾコート、ジフェンゾコート - メチルスルファート、ジメチピン、D S M A、ジムロン、エンドタール及びその塩、エトベンザニド、フランプロブ、フランプロブ - イソプロピル、フランプロブ - メチル、フランプロブ - M - イソプロピル、フランプロブ - M - メチル、フルレノール、フルレノール - ブチル、フルルプイミドール、ホサミン、ホサミン - アンモニウム、インダノファン、インダジフラム、マレイン酸ヒドラジド、メフルイジド、メタム、メチルアジド、メチルプロミド、メチル - ジムロン、ヨウ化メチル、M S M A、オレイン酸、オキサジクロメホン、ペラルゴン酸、ピリブチカルブ、キノクラミン、トリ - アジフラム、トリジファン及び 6 - クロロ - 3 - (2 - シクロプロピル - 6 - メチルフェノキシ) - 4 - ピリダジノール (C A S 4 9 9 2 2 3 - 4 9 - 3) 及びその塩並びにエステルからなる群から選択される他の除草剤。

10

20

【 0 1 6 0 】

好ましいのは、除草剤の群 b 2、b 3、b 4、b 5、b 6、b 7、b 9、b 1 0 及び b 1 3 から選択される少なくとも 1 種の除草剤 B を含んでなる本発明による組成物である。

30

【 0 1 6 1 】

特に好ましいのは、除草剤の群 b 4、b 6 及び b 1 0 から選択される少なくとも 1 種の除草剤 B を含んでなる本発明による組成物である。

【 0 1 6 2 】

本発明による式 I のベンゾオキサジノンとの組み合わせで用いることができる除草剤 B の例は :

b 1) 脂質生合成阻害剤の群からは :

A C C 系除草剤、例えばアロキシジム、アロキシジム - ナトリウム、プトロキシジム、クレトジム、クロジナホブ、クロジナホブ - プロパルギル、シクロキシジム、シハロホブ、シハロホブ - ブチル、ジクロホブ、ジクロホブ - メチル、フェノキサプロブ、フェノキサプロブ - エチル、フェノキサプロブ - P、フェノキサプロブ - P - エチル、フルアジホブ、フルアジホブ - ブチル、フルアジホブ - P、フルアジホブ - P - ブチル、ハロキシホブ、ハロキシホブ - メチル、ハロキシホブ - P、ハロキシホブ - P - メチル、メタミホブ、ピノキサデン、プロホキシジム、プロパキサホブ、キサロホブ、キサロホブ - エチル、キサロホブ - テフリル、キサロホブ - P、キサロホブ - P - エチル、キサロホブ - P - テフリル、セトキシジム、テブラロキシジム及びトラルコキシジム、さらには非 A C C 系除草剤、例えばベンフレサート、ブチラート、シクロアート、ダラボン、ジメピペラート、E P T C、エスプロカルブ、エトフメサート、フルプロパナート、モリナート、オルベンカルブ、ペブラート、プロスルホカルブ、T C A、チオベンカルブ、チオカルバジル、トリ

40

50

アラート及びベルノラート；

b 2) A L S 阻害剤の群からは：

スルホニル尿素系、例えばアミドスルフロン、アジムスルフロン、ベンスルフロン、ベンスルフロン - メチル、クロリムロン、クロリムロン - エチル、クロルスルフロン、シノスルフロン、シクロスルファミロン、エタメトスルフロン、エタメトスルフロン - メチル、エトキシスルフロン、フラザスルフロン、フルセトスルフロン、フルピルスルフロン、フルピルスルフロン - メチル - ナトリウム、ホラムスルフロン、ハロスルフロン、ハロスルフロン - メチル、イマゾスルフロン、ヨードスルフロン、ヨードスルフロン - メチル - ナトリウム、メソスルフロン、メタゾスルフロン、メトスルフロン、メトスルフロン - メチル、ンイコスルフロン、オルトスルファミロン、オキサスルフロン、プリミスルフロン、プリミスルフロン - メチル、プロピリスルフロン、プロスルフロン、ピラゾスルフロン、ピラゾスルフロン - エチル、リムスルフロン、スルホメツロン、スルホメツロン - メチル、スルホスルフロン、チフェンスルフロン、チフェンスルフロン - メチル、トリアスルフロロン、トリベヌロン、トリベヌロン - メチル、トリフロキシスルフロン、トリフルスルフロロン、トリフルスルフロン - メチル及びトリトスルフロン、イミダゾリノン系、例えばイマザメタベンゾ、イマザメタベンゾ - メチル、イマザモックス、イマザピック、イマザピル、イマザキン及びイマゼタピル、トリアゾロピリミジン系除草剤並びにスルホンアニリド系、例えばクロランスラム、クロランスラム - メチル、ジクロスラム、フルメツラム、フロラスラム、メトスラム、ペノキッスラム、ピリミスルファン及びピロキッスラム、ピリミジニルベンゾアート系、例えばビスピリバク、ビスピリバク - ナトリウム、ピリベンゾオキシム、ピリフタリド、ピリミノバク、ピリミノバク - メチル、ピリチオバク、ピリチオバク - ナトリウム、4 - [[[2 - [(4 , 6 - ジメトキシ - 2 - ピリミジニル) オキシ] フェニル] メチル] アミノ] - 安息香酸 - 1 - メチルエチルエステル (C A S 4 2 0 1 3 8 - 4 1 - 6)、4 - [[[2 - [(4 , 6 - ジメトキシ - 2 - ピリミジニル) オキシ] フェニル] メチル] アミノ] - 安息香酸プロピルエステル (C A S 4 2 0 1 3 8 - 4 0 - 5)、N - (4 - プロモフェニル) - 2 - [(4 , 6 - ジメトキシ - 2 - ピリミジニル) オキシ] ベンゼンメタンアミン (C A S 4 2 0 1 3 8 - 0 1 - 8) 並びにスルホニルアミノカルボニル - トリアゾリノン系除草剤、例えばフルカルバゾン、フルカルバゾン - ナトリウム、プロボキシカルバゾン、プロボキシカルバゾン - ナトリウム、チエンカルバゾン及びチエンカルバゾン - メチル (これらの中でも、本発明の好ましい実施形態は、少なくとも 1 種のイミダゾリノン系除草剤を含んでなる組成物に関係する) ；

b 3) 光合成阻害剤の群からは：

アミカルバゾン、光化学系 I I の阻害剤、例えばトリアジン系除草剤 (クロロトリアジン、トリアジノン系、トリアジンジオン系、メチルチオトリアジン系及びピリダジノン系の除草剤を含めて) 例えばアメトリン、アトラジン、クロリダゾン、シアナジン、デスメトリン、ジメタメトリン、ヘキサジノン、ムトリブジン、プロメトン、プロメトリン、プロバジン、シマジン、シメトリン、テルブメトン、テルブチルアジン、テルプトリン及びトリエタジン、アリール尿素系クロロプロムロン、クロロトルロン、クロロキスロン、ジメフロン、ジウロン、フルオメツロン、イソプロツロン、イソウロン、リヌロン、メタミトロン、メタベンズチアズロン、メトベンズロン、メトキスロン、モノリヌロン、ネブロン、シズロン、トブチウロン及びチアジアズロン、フェニルカルバマート系、例えばデスマジファミン、カルブチラト、フェンムジファミン、フェンムジファミン - エチル、ニトリル系除草剤、例えばプロモフェノキシム、プロモキシニル及びその塩並びにエステル、イオキシニル及びその塩並びにエステル、ウラシル系、例えばプロマシル、レナシル及びテルバシル、さらにはベンタゾン並びにベンタゾン - ナトリウム、ピリダート、ピリダホール、ペンタノクロル及びプロブアニル、及び、光化学系 I の阻害剤、例えばジコート、ジコート - ジプロミド、パラコート、パラコート - ジクロリド及びパラコート - ジメチルスルファート (これらの中でも、本発明の好ましい実施形態は、少なくとも 1 種のアリール尿素系除草剤を含んでなる組成物に関し；これらの中でも、同様に、本発明の好ましい実施形態は、少なくとも 1 種のトリアジン系除草剤を含んでなる組成物に関する。これらの中でも

10

20

30

40

50

、同様に、本発明の好ましい実施形態は、少なくとも1種のニトリル系除草剤を含んでなる組成物に係する)；

b 4) プロトポルフィリノゲン - IX オキシダーゼ阻害剤の群からは：

アシフルオルフェン、アシフルオルフェン - ナトリウム、アザフェニジン、ベンカルバゾン、ベンズフェンジゾン、ピフェノキス、ブタフェナシル、カルフェントラゾン、カルフェントラゾン - エチル、クロメトキシフェン、シニドン - エチル、フルアゾラート、フルフェンビル、フルフェンビル - エチル、フルミクロラク、フルミクロラク - ベンチル、フルミオキサジン、フルオログリコフェン、フルオログリコフェン - エチル、フルチアセト、フルチアセト - メチル、ホメサフェン、ハロサフェン、ラクトフェン、オキサジアルギル、オキサジアゾン、オキシフルオルフェン、ペントキサゾン、プロフルアゾール、ピラクロニル、ピラフルフェン、ピラフルフェン - エチル、サフルフェナシル、スルフェントラゾン、チジアジミン、エチル [3 - [2 - クロロ - 4 - フルオロ - 5 - (1 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 3 - イル) フェノキシ] - 2 - ピリジルオキシ] アセタート (CAS 353292 - 31 - 6 ; S - 3100)、N - エチル - 3 - (2 , 6 - ジクロロ - 4 - トリフルオロメチルフェノキシ) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - カルボキサミド (CAS 452098 - 92 - 9)、N - テトラヒドロフルフリル - 3 - (2 , 6 - ジクロロ - 4 - トリフルオロメチルフェノキシ) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - カルボキサミド (CAS 915396 - 43 - 9)、N - エチル - 3 - (2 - クロロ - 6 - フルオロ - 4 - トリフルオロメチルフェノキシ) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - カルボキサミド (CAS 452099 - 05 - 7)、N - テトラヒドロフルフリル - 3 - (2 - クロロ - 6 - フルオロ - 4 - トリフルオロメチルフェノキシ) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 1 - カルボキサミド (CAS 45100 - 03 - 7)、3 - [7 - フルオロ - 3 - オキソ - 4 - (プロブ - 2 - イニル) - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [1 , 4] オキサジン - 6 - イル] - 1 , 5 - ジメチル - 6 - チオキソ - [1 , 3 , 5] トリアジナン - 2 , 4 - ジオン、1 , 5 - ジメチル - 6 - チオキソ - 3 - (2 , 2 , 7 - トリフルオロ - 3 - オキソ - 4 - (プロブ - 2 - イニル) - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [b] [1 , 4] オキサジン - 6 - イル) - 1 , 3 , 5 - トリアジナン - 2 , 4 - ジオン、2 - (2 , 2 , 7 - トリフルオロ - 3 - オキソ - 4 - プロバ - 2 - イニル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [1 , 4] オキサジン - 6 - イル) - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - イソインドール - 1 , 3 - ジオン及び 1 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 - (2 , 2 , 7 - トリフルオロ - 3 - オキソ - 4 - プロバ - 2 - イニル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [1 , 4] オキサジン - 6 - イル) - 1 H - ピリミジン - 2 , 4 - ジオン；

b 5) 白化除草剤の群からは：

PDS 阻害剤：ペフルプトアミド、ジフルフェニカン、フルリドン、フルロクロリドン、フルルタモン、ノルフルラゾン、ピコリナフェン、さらには 4 - (3 - トリフルオロメチルフェノキシ) - 2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピリミジン (CAS 180608 - 33 - 7)、HPD 阻害剤：ベンゾピシクロン、ベンゾフェナブ、クロマゾン、イソキサフルトール、メソトリオン、ピラスルホトール、ピラゾリナート、ピラゾキシフェン、スルコトリオン、テフリルトリオン、テンボトリオン、トブラメゾン及びピシクロピロン、白化剤 (標的不明)：アクロニフェン、アミトロール及びフルメツロン；

b 6) EPS シンターゼ阻害剤の群からは：

グリホサート、グリホサート - イソプロピルアンモニウム、グリホサート - カリウム及びグリホサート - トリメシウム (スルホサート) ；

b 7) グルタミンシンターゼ阻害剤の群からは：

ピラナホス (ピアラホス)、ピラナホス - ナトリウム、グルホシナート、グルホシナート - P 及びグルホシナート - アンモニウム；

b 8) DHP シンターゼ阻害剤の群からは：

アスラム；

b 9) 有糸分裂阻害剤の群からは：

10

20

30

40

50

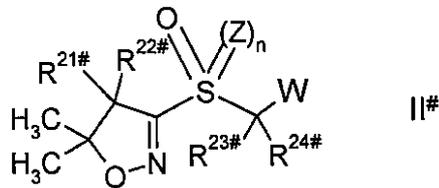
群 K 1 の化合物：ジニトロアニリン系、例えばベンフルラリン、ブトラリン、ジニトロアミン、エタルフルラリン、フルクロラリン、オリザリン、ペンジメタリン、プロジアミン及びトリフルラリン、ホスホルアミダート系、例えばアミプロホス、アミプロホス - メチル、さらにはブタミホス、安息香酸系除草剤、例えばクロルタール、クロルタール - ジメチル、ピリジン系、例えばジチオピル及びチアゾピル、ベンズアミド系、例えばプロピズアミド及びトブタム；群 K 2 の化合物：クロルプロファミ、プロファミ及びカルベトアミド（これらの中でも、群 K 1 の化合物、特にジニトロアニリン系が好ましい）；

b 10) VL C F A 阻害剤の群からは：

クロロアセトアミド系、例えばアセトクロル、アラクロル、ブタクロル、ジメタクロル、ジメテンアミド、ジメテンアミド - P、メタザクロル、メトラクロル、メトラクロル - S、ペトキサミド、プレチラクロル、プロパクロル、プロピソクロル及びテニルクロル、オキシアセトアニリド系、例えばフルフェンアセト及びメフェンアセト、アセトアニリド系、例えばジフェンアミド、ナプロアニリド及びナプロブアミド、テトラゾリノン系、例えばフェントラズアミド、さらには他の除草剤系、例えばアニロホス、カフェンストロール、フェノキサスルホン、イペンカルバゾン、ピペロホス、ピロキサスルホン並びに式 I I #

10

【化 2 5】



20

【 0 1 6 3】

[式中の $R^{21\#}$ 、 $R^{22\#}$ 、 $R^{23\#}$ 、 $R^{24\#}$ 、W、Z 及び n は以下の各意味を有している：

$R^{21\#}$ 、 $R^{22\#}$ 、 $R^{23\#}$ 、 $R^{24\#}$ 互いに独立して水素、ハロゲン又は $C_1 \sim C_4$ - アルキル；

W 環員として酸素、窒素及びイオウから選択される 1、2 又は 3 個の同じ又は異なるヘテロ原子を、炭素環員に加えて含有しているフェニル又は単環式 5、6、7、8、9 若しくは 10 員ヘテロシクリル（このフェニル及びヘテロシクリルは不置換であるか又はハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキル及び $C_1 \sim C_4$ - ハロアルコキシから選択される 1、2 又は 3 個の置換基 R^{yy} を有している）、好ましくは環員として 1、2 又は 3 個の窒素原子を、炭素環員に加えて含有しているフェニル又は 5 若しくは 6 員芳香族ヘテロシクリル（ヘタリール）（このフェニル及びヘタリールは不置換であるか又は 1、2 又は 3 個の置換基 R^{yy} を有している）；

30

Z 酸素又は NH；

n 0 又は 1]

で表されるイソオキサゾリン化合物；

式 I I # で表されるイソオキサゾリン化合物の中でも、好ましいのは、

$R^{21\#}$ 、 $R^{22\#}$ 、 $R^{23\#}$ 、 $R^{24\#}$ は互いに独立して H、F、Cl 又はメチルである；

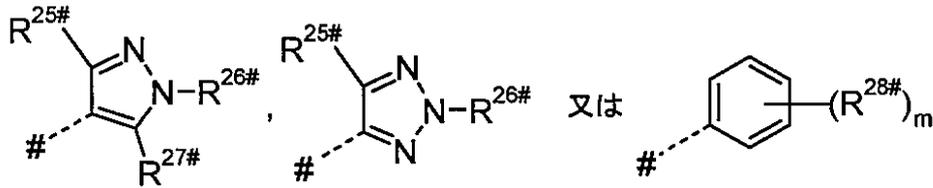
40

Z は酸素である；

n は 0 又は 1 である；

W はフェニル、ピラゾリル又は 1, 2, 3 - トリアゾリルである（この最後に言及した 3 基は不置換であるか又は 1、2 又は 3 個の置換基 R^{yy} 、特に以下の各基

【化26】



【0164】

[式中、

$R^{25\#}$ は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル又は $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルであり；

$R^{26\#}$ は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり；

$R^{27\#}$ は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシであり；

$R^{28\#}$ は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル又は $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシであり；

m は、0、1、2又は3であり；

$\#$ は、基 $C R^{23\#} R^{24\#}$ への結合点を表している]

のうちの1つを有している)；

式II#で表されるイソキサゾリン化合物であり、

式II#で表されるイソキサゾリン化合物の中でも、特に好ましいのは、

$R^{21\#}$ は水素である；

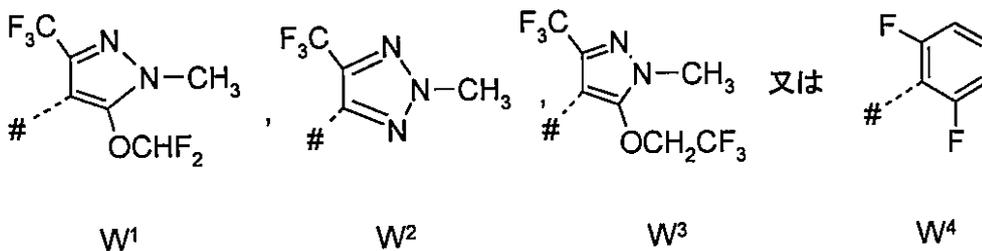
$R^{22\#}$ はフッ素である；

$R^{23\#}$ は水素又はフッ素である；

$R^{24\#}$ は水素又はフッ素である；

W は、式 W^1 、 W^2 、 W^3 又は W^4

【化27】

W¹W²W³W⁴

【0165】

[式中の $\#$ は基 $C R^{23\#} R^{24\#}$ への結合点を表している]

で表される各基のうちの1つである；

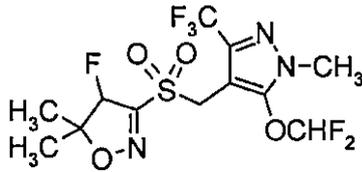
Z は酸素である；

n は0又は1(特には1)である；

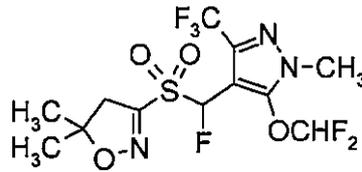
式II#で表されるイソキサゾリン化合物であり、

これらの中でも、非常に好ましいのは、式II#.1、II#.2、II#.3、II#.4、II#.5、II#.6、II#.7、II#.8及びII#.9

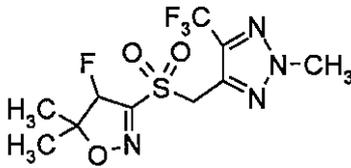
【化 2 8】



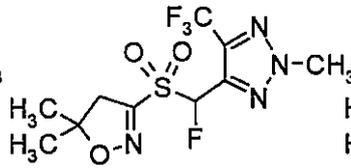
II#.1



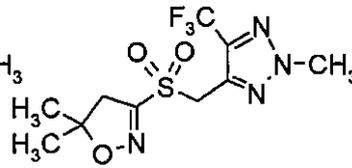
II#.2



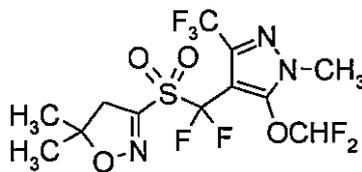
II#.3



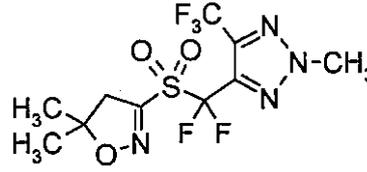
II#.4



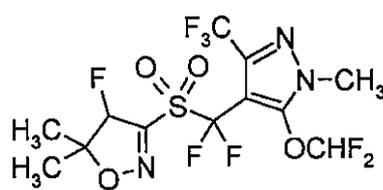
II#.5



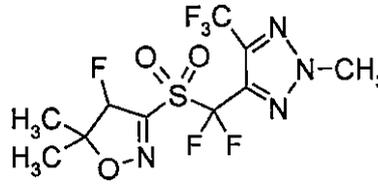
II#.6



II#.7



II#.8



II#.9

10

20

30

【 0 1 6 6 】

で表されるイソキサゾリン化合物であり、

式 II # で表されるイソキサゾリン化合物は当技術分野で公知のものであって、例えば WO 2006/024820、WO 2006/037945、WO 2007/071900 及び WO 2007/096576 に記載されており、

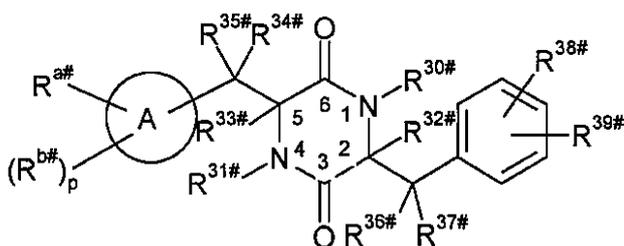
VLCFA 阻害剤の中でも、好ましいのは、クロロアセトアミド系及びオキシアセトアミド系である；

b 1 1) セルロース生合成阻害剤の群からは：

クロルチアミド、ジクロベニル、フルポキサム、イソキサベン、1-シクロヘキシル-5-ペンタフルオルフェニルオキシ-14-[1,2,4,6]チアトリアジン-3-イルアミン並びに式 III I

40

【化 2 9】



III#,

50

【 0 1 6 7 】

[この式においては、

Aは、フェニル又はピリジル(ここで、 $R^{a \#}$ は、Aの炭素原子への結合点に対してオルト位に結合されている)であり；

$R^{a \#}$ は、CN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $D-C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、 $O-D-C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $S(O)_q R^y$ 、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $D-C_3 \sim C_6$ -シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ -アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ -アルキニルオキシ、 $NR^A R^B$ 、トリ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルシリル、 $D-C(=O)-R^{a 1}$ 、 $D-P(=O)(R^{a 1})_2$ 、フェニル、ナフチル、

10

O、N及びSからなる群から選択される1、2、3又は4個のヘテロ原子を含有していて、基 $R^{a a}$ 及び/又は $R^{a 1}$ 、並びに、 R^a が炭素原子に結合されている場合は、さらにはハロゲンによって部分的又は完全に置換されていて良い、炭素又は窒素を介して結合されている3~7員単環式又は9若しくは10員二環式飽和、不飽和若しくは芳香族ヘテロ環

であり、

R^y は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_3 \sim C_4$ -アルケニル、 $C_3 \sim C_4$ -アルキニル、 $NR^A R^B$ 又は $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルであり、qは0、1又は2であり、

R^A 、 R^B は、互いに独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -アルケニル及び $C_3 \sim C_6$ -アルキニルであり；それらが結合されている窒素原子と一緒にあって、 R^A 、 R^B は、O、N及びSからなる群から選択される1、2又は3個のヘテロ原子を、炭素原子に加えて含有していて良い5若しくは6員飽和、部分又は完全不飽和環を形成していても良く、この環は1~3個の基 $R^{a a}$ によって置換されていて良く、

20

Dは、共有結合、 $C_1 \sim C_4$ -アルキレン、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル又は $C_2 \sim C_6$ -アルキニルであり、

$R^{a 1}$ は、水素、OH、 $C_1 \sim C_8$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_2 \sim C_8$ -アルケニル、 $C_5 \sim C_6$ -シクロアルケニル、 $C_2 \sim C_8$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_8$ -アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_8$ -アルキニルオキシ、 $NR^A R^B$ 、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシアミノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルアミノスルホニルアミノ、[ジ-($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ]スルホニルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ -アルケニルアミノ、 $C_3 \sim C_6$ -アルキニルアミノ、N-($C_2 \sim C_6$ -アルケニル)-N-($C_1 \sim C_6$ -アルキル)アミノ、N-($C_2 \sim C_6$ -アルキニル)-N-($C_1 \sim C_6$ -アルキル)アミノ、N-($C_1 \sim C_6$ -アルコキシ)-N-($C_1 \sim C_6$ -アルキル)アミノ、N-($C_2 \sim C_6$ -アルケニル)-N-($C_1 \sim C_6$ -アルコキシ)アミノ、N-($C_2 \sim C_6$ -アルキニル)-N-($C_1 \sim C_6$ -アルコキシ)-アミノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニル、トリ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルシリル、フェニル、フェノキシ、フェニルアミノ、又は

30

O、N及びSからなる群から選択される1、2、3又は4個のヘテロ原子を含有している5若しくは6員単環式又は9若しくは10員二環式ヘテロ環(ここで、この環式基は、不置換であるか又は1、2、3又は4個の基 $R^{a a}$ によって置換されている)であり、

40

$R^{a a}$ は、ハロゲン、OH、CN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、 $S(O)_q R^y$ 、 $D-C(=O)-R^{a 1}$ 及びトリ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルシリルであり；

R^b は、互いに独立して、水素、CN、 NO_2 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ -アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、ベンジル又は $S(O)_q R^y$ であり、

$R^{b \#}$ は、隣接環原子に結合されている基 R^a 又は R^b と一緒にあって、O、N及びSからなる群から選択される1、2又は3個のヘテロ原子を、炭素原子に加えて含有していて良い5若しくは6員飽和又は部分若しくは完全不飽和環を形成していても良く(この環

50

は $R^{a a}$ によって部分的又は完全に置換されていて良い) ;

p は、0、1、2又は3であり ;

$R^{3 0 \#}$ は、水素、OH、CN、 $C_1 \sim C_{1 2}$ -アルキル、 $C_3 \sim C_{1 2}$ -アルケニル、 $C_3 \sim C_{1 2}$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_5 \sim C_6$ -シクロアルケニル、 $NR^A R^B$ 、 $S(O)_n R^y$ 、 $S(O)_n NR^A R^B$ 、 $C(=O)R^{4 0 \#}$ 、 $CONR^A R^B$ 、フェニル、又は

O、N及びSからなる群から選択される1、2、3又は4個のヘテロ原子を含有している5若しくは6員単環式又は9若しくは10員二環式芳香族ヘテロ環(ここで、この環式基は D^1 を介して結合されていて、不置換であるか又は1、2、3又は4個の基 $R^{a a}$ 、並びに以下の部分又は完全 $R^{a a}$ -置換基： $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_3 \sim C_4$ -アルケニル、 $C_3 \sim C_4$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_5 \sim C_6$ -シクロアルケニル、 $NR^A R^B$ 、 $S(O)_n R^y$ 、 $S(O)_n NR^A R^B$ 、 $C(=O)R^{4 0}$ 及び $CONR^A R^B$ によって置換されている)であり、

$R^{4 0 \#}$ は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシであり、

D^1 は、カルボニル又は基Dであり、

ここで、基 $R^{3 0}$ 、 R^a 並びにそれらの従属置換基においては、その炭素鎖及び/又は環式基は、1、2、3又は4個の置換基 $R^{a a}$ 及び/又は $R^{a 1}$ を有していて良く ;

$R^{3 1 \#}$ は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_3 \sim C_4$ -アルケニル又は $C_3 \sim C_4$ -アルキニルであり ;

$R^{3 2 \#}$ は、OH、 NH_2 、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ -ヒドロキシアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -シアノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル又は $C(=O)R^{4 0}$ であり ;

$R^{3 3 \#}$ は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル又は $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルであり、又は $R^{3 3 \#}$ 及び $R^{3 4 \#}$ は一緒になって共有結合であり ;

$R^{3 4 \#}$ 、 $R^{3 5 \#}$ 、 $R^{3 6 \#}$ 、 $R^{3 7 \#}$ は、互いに独立して、水素、ハロゲン、OH、CN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルケニル及び $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキニルであり ;

$R^{3 8 \#}$ 、 $R^{3 9 \#}$ は、互いに独立して、水素、ハロゲン、OH、ハロアルキル、 $NR^A R^B$ 、 $NR^A C(O)R^{4 1}$ 、CN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ -アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、 $O-C(O)R^{4 1}$ 、フェノキシ又はベンジルオキシであり(ここで、基 $R^{3 8 \#}$ 及び $R^{3 9 \#}$ においては、その炭素鎖及び/又は環式基は1、2、3又は4個の置換基 $R^{a a}$ を有していて良い) ;

$R^{4 1 \#}$ は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル又は $NR^A R^B$ である]

で表されるピペラジン化合物 ;

式III#で表されるピペラジン化合物の中でも、好ましいのは、

Aはフェニル又はピリジル(ここで、 R^a は、Aの炭素原子への結合点に対してオルト位に結合されている)である ;

$R^a \#$ はCN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ又は $D-C(=O)-R^{a 1}$ であり、

R^y は $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_3 \sim C_4$ -アルケニル、 $C_3 \sim C_4$ -アルキニル、 $NR^A R^B$ 又は $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルであり、 q は0、1又は2であり、

R^A 、 R^B は、互いに独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -アルケニル及び $C_3 \sim C_6$ -アルキニルであり ; それらが結合されている窒素原子と一緒にあって、 R^A 、 R^B は、O、N及びSからなる群から選択される1、2又は3個のヘテロ原子を、炭素原子に加えて含有していて良い5若しくは6員飽和、部分又は完全不飽和環を形成

10

20

30

40

50

していても良く（この環は 1 ~ 3 個の基 $R^{a a}$ によって置換されていて良い）、

D は共有結合又は $C_1 \sim C_4$ - アルキレンであり、

$R^{a 1}$ は水素、OH、 $C_1 \sim C_8$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルであり、

$R^{a a}$ はハロゲン、OH、CN、 NO_2 、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ - ハロアルコキシ、 $S(O)_q R^y$ 、 $D - C(=O) - R^{a 1}$ 及びトリ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルシリルである；

R^b は、互いに独立して、CN、 NO_2 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ - アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ - アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ - ハロアルコキシ、ベンジル又は $S(O)_q R^y$ であり、

$R^{b \#}$ は、隣接環原子に結合されている基 R^a 又は R^b と一緒になって、O、N 及び S からなる群から選択される 1、2 又は 3 個のヘテロ原子を、炭素原子に加えて含有している良い 5 若しくは 6 員飽和又は部分若しくは完全不飽和環を形成していても良い（この環は $R^{a a}$ によって部分的又は完全に置換されていて良い）；

p は 0 又は 1 である；

$R^{3 0 \#}$ は水素、 $C_1 \sim C_{1 2}$ - アルキル、 $C_3 \sim C_{1 2}$ - アルケニル、 $C_3 \sim C_{1 2}$ - アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ又は $C(=O)R^{4 0 \#}$ であり、 $R^{a a}$ によって部分的に又は完全に置換されていて良く、

$R^{4 0 \#}$ は水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ - ハロアルコキシ（この環は $R^{a a}$ によって部分的又は完全に置換されていて良い）であり、

ここで、基 $R^{3 0 \#}$ 、 $R^{a \#}$ 並びにそれらの従属置換基においてはその炭素鎖及び / 又は環式基は 1、2、3 又は 4 個の置換基 $R^{a a}$ 及び / 又は $R^{a 1}$ を有している良い；

$R^{3 1 \#}$ は $C_1 \sim C_4$ - アルキルである；

$R^{3 2 \#}$ は OH、 NH_2 、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキル又は $C(=O)R^{2 5}$ である；

$R^{3 3 \#}$ は水素であるか、又は $R^{3 3}$ と $R^{3 4}$ は一緒になって共有結合である；

$R^{3 4 \#}$ 、 $R^{3 5 \#}$ 、 $R^{3 6 \#}$ 、 $R^{3 7 \#}$ は互いに独立して水素である；

$R^{3 8 \#}$ 、 $R^{3 9 \#}$ は互いに独立して水素、ハロゲン又は OH である；

式 I I I $\#$ で表されるピペラジン化合物である；

b 1 2) デカップラー型除草剤の群からは：

ジノセブ、ジノテルブ及び D N O C 並びにその塩；

b 1 3) オーキシソ型除草剤の群からは：

2, 4 - D 及びその塩並びにエステル、2, 4 - D B 及びその塩並びにエステル、アミノピラリド及びその塩、例えばアミノピラリド - トリス (2 - ヒドロキシプロピル) アンモニウム及びその塩、ベナゾリン、ベナゾリン - エチル、クロランベン及びその塩並びにエステル、クロムプロブ、クロピラリド及びその塩並びにエステル、ジカンバ及びその塩並びにエステル、ジクロルプロブ及びその塩並びにエステル、ジ - クロルプロブ - P 及びその塩並びにエステル、フルロキシピル、フルロキシピル - ブトメチル、フルロキシピル - メブチル、M C P A 及びその塩並びにエステル、M C P A - チオエチル、M C P B 及びその塩並びにエステル、メコプロブ及びその塩並びにエステル、メコプロブ - P 及びその塩並びにエステル、ピクロラム及びその塩並びにエステル、キンクロラク、キンメラク、T B A (2, 3, 6) 及びその塩並びにエステル、トリクロピル及びその塩並びにエステル、さらにはアミノシクロピラクロル及びその塩並びにエステル；

b 1 4) オーキシソ輸送阻害剤の群からは：

ジフルフェンゾピル、ジフルフェンゾピル - ナトリウム、ナブタラム及びナブタラム - ナトリウム；

b 1 5) 他の除草剤の群からは：

プロモブチド、クロルフルレノール、クロルフルレノール - メチル、シンメチリン、クミルウロン、ダラボン、ダゾメト、ジフェンゾコート、ジフェンゾコート - メチルスルファ

10

20

30

40

50

ート、ジメチピン、DSMA、ジムロン、エンドタール及びその塩、エトベンザニド、フランプロブ、フランプロブ-イソプロピル、フランプロブ-メチル、フランプロブ-M-イソプロピル、フランプロブ-M-メチル、フルレノール、フルレノール-ブチル、フルルプイミドール、ホサミン、ホサミン-アンモニウム、インダノファン、インダジフラム、マレイン酸ヒドラジド、メフルイジド、メタム、メチオゾリン(CAS 403640-27-7)、メチルアジド、メチルプロミド、メチル-ジムロン、ヨウ化メチル、MSMA、オレイン酸、オキサジクロメホン、ペラルゴン酸、ピリプチカルブ、キノクラミン、トリアジフラム、トリジファンさらには6-クロロ-3-(2-シクロプロピル-6-メチルフェノキシ)-4-ピリダジノール(CAS 499223-49-3)及びその塩並びにエステル；

である。

【0168】

さらには、式Iのベンゾオキサジノンをセーフナーとの組み合わせで施用するのが有効であり得る。セーフナーは、望まれていない植物に対する式Iのベンゾオキサジノンの除草活性に大きく影響することなしに有用植物に対する損傷を回避又は軽減する化学化合物である。セーフナーは、有用植物の播種前か(例えば種子、枝又は苗木への処置で)又は発芽前施用若しくは発芽後施用で施用され得る。セーフナーと式Iのベンゾオキサジノンは同時的に又は連続的に施用され得る。

【0169】

適するセーフナーは、例えば(キノリン-8-オキシ)酢酸系、1-フェニル-5-ハロアルキル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-カルボン酸系、1-フェニル-4,5-ジヒドロ-5-アルキル-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸系、4,5-ジヒドロ-5,5-ジアリール-3-イソオキサゾールカルボン酸系、ジクロロアセトアミド系、-オキシミノフェニルアセトニトリル系、アセトフェノンオキシム系、4,6-ジハロ-2-フェニルピリミジン系、N-[[4-(アミノカルボニル)フェニル]スルホニル]-2-安息香酸アミド系、1,8-ナフタル酸無水物、2-ハロ-4-(ハロアルキル)-5-チアゾールカルボン酸系、ホスホルチオラート系及びN-アルキル-O-フェニルカルバマート系並びにこれらの農薬として許容される塩及び誘導体、例えばアミド、エステル、さらにはチオエステル(但しこれらが酸基を有しているとして)である。

【0170】

好ましいセーフナーCの例は、ベノキサコル、クロキントセット、シオメトリニル、シプロスルファミド、ジクロルミド、ジシクロノナ、ジエトラート、フェンクロラゾール、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン、メフェンピル、メフェナート、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、4-(ジクロロアセチル)-1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン(MON4660、CAS 71526-07-3)及び2,2,5-トリメチル-3-(ジクロロアセチル)-1,3-オキサゾリジン(R-29148、CAS 52836-31-4)である。

【0171】

非常に好ましいセーフナーCは、ベノキサコル、クロキントセット、シプロスルファミド、ジクロルミド、フェンクロラゾール、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン、メフェンピル、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、4-(ジクロロアセチル)-1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン(MON4660、CAS 71526-07-3)及び2,2,5-トリメチル-3-(ジクロロアセチル)-1,3-オキサゾリジン(R-29148、CAS 52836-31-4)である。

【0172】

特に好ましいセーフナーCは、ベノキサコル、クロキントセット、シプロスルファミド、ジクロルミド、フェンクロラゾール、フェンクロリム、フリラゾール、イソキサジフェン、メフェンピル、ナフタル酸無水物、4-(ジクロロアセチル)-1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン(MON4660、CAS 71526-07-3)及び2,

10

20

30

40

50

2, 5 - トリメチル - 3 - (ジクロロアセチル) - 1, 3 - オキサゾリジン (R - 29148、CAS 52836 - 31 - 4) である。

【0173】

群 b 1) ~ b 15) の活性化化合物並びにセーフナー C は公知の除草剤、セーフナーであり、例えば、The Compendium of Pesticide Common Names (<http://www.alanwood.net/pesticides/>); B. Hock, C. Fedtke, R. R. Schmidt, Herbicide [Herbicides], Georg Thieme Verlag, Stuttgart, 1995 を参照されたい。別の除草活性化化合物は WO 96 / 26202、WO 97 / 41116、WO 97 / 41117、WO 97 / 41118、WO 01 / 83459 及び WO 2008 / 074991 並びに W. Kramer et al. (ed.) "Modern Crop Protection Compounds", Vol. 1, Wiley VCH, 2007 及びそこに引用されている文献に記載されている。

10

【0174】

本発明は、また、式 I で表される少なくとも 1 種のベンゾオキサジノンと (好ましくは活性化化合物の群 b 1 ~ b 15 から選択される) 少なくとも 1 種の別の活性化化合物とを含んでいる活性化化合物組み合わせ、及び、少なくとも 1 種の固体又は液体担体及び / 又は 1 種又はそれ以上の界面活性剤及び (望まれる場合は) 作物保護組成物に慣用の 1 種又はそれ以上の別の助剤を含んでなる 1 成分組成物として製剤化された作物保護組成物の形態にある組成物に関する。

【0175】

本発明は、また、式 I で表される少なくとも 1 種のベンゾオキサジノン、固体又は液体担体及び / 又は 1 種又はそれ以上の界面活性剤を含んでいる第 1 成分と、活性化化合物の群 b 1 ~ b 15 から選択される少なくとも 1 種の別の活性化化合物、固体又は液体担体及び / 又は 1 種又はそれ以上の界面活性剤を含んでいる第 2 成分とを含んでなる 2 成分組成物として製剤化された作物保護組成物の形態にある組成物に関する (ここでさらに、第 1 及び第 2 成分は、いずれも、作物保護組成物に慣用の別の助剤を含んでいても良い)。

20

【0176】

少なくとも 1 種の成分 A としての式 I で表される化合物と少なくとも 1 種の除草剤 B とを含んでなる二成分組成物においては、その活性化化合物の重量比 A : B は一般的には 1 : 1000 ~ 1000 : 1 の範囲内、好ましくは 1 : 500 ~ 500 : 1 の範囲内、特には 1 : 250 ~ 250 : 1 の範囲内、特に好ましくは 1 : 75 ~ 75 : 1 の範囲内にある。

30

【0177】

少なくとも 1 種の成分 A としての式 I で表される化合物と少なくとも 1 種のセーフナー C とを含んでなる二成分組成物においては、その活性化化合物の重量比 A : C は一般的には 1 : 1000 ~ 1000 : 1 の範囲内、好ましくは 1 : 500 ~ 500 : 1 の範囲内、特には 1 : 250 ~ 250 : 1 の範囲内、特に好ましくは 1 : 75 ~ 75 : 1 の範囲内にある。

【0178】

少なくとも 1 種の成分 A としての式 I で表される化合物と少なくとも 1 種の除草剤 B と少なくとも 1 種のセーフナー C とを含んでなる三成分組成物においては、その成分の相対重量部 A : B は一般的には 1 : 1000 ~ 1000 : 1 の範囲内、好ましくは 1 : 500 ~ 500 : 1 の範囲内、特には 1 : 250 ~ 250 : 1 の範囲内、特に好ましくは 1 : 75 ~ 75 : 1 の範囲内にあり; その成分の重量比 A : C は一般的には 1 : 1000 ~ 1000 : 1 の範囲内、好ましくは 1 : 500 ~ 500 : 1 の範囲内、特には 1 : 250 ~ 250 : 1 の範囲内、特に好ましくは 1 : 75 ~ 75 : 1 の範囲内にあり; その成分の重量比 B : C は一般的には 1 : 1000 ~ 1000 : 1 の範囲内、好ましくは 1 : 500 ~ 500 : 1 の範囲内、特には 1 : 250 ~ 250 : 1 の範囲内、特に好ましくは 1 : 75 ~ 75 : 1 の範囲内にある。好ましくは、成分 A + B 対成分 C の重量比は、1 : 500 ~ 500 : 1 の範囲内、特には 1 : 250 ~ 250 : 1 の範囲内、特に好ましくは 1 : 75 ~ 75 : 1 の範囲内にある。

40

【0179】

50

特に好ましい除草剤 B は先に定義されている除草剤 B であるが、特に以下の表 B :

【表 2】

表 B:

	除草剤 B
B.1	クレトジム
B.2	クロジナホブ-プロパルギル
B.3	シクロキシジム
B.4	シハロホブ-ブチル
B.5	フェノキサプロブ-P-エチル
B.6	メタミホブ
B.7	ピノキサデン
B.8	プロホキシジム
B.9	セトキシジム
B.10	テプラロキシジム
B.11	トラルコキシジム
B.12	エスプロカルブ
B.13	エトフメサート
B.14	モリナート
B.15	プロスルホカルブ
B.16	チオベンカルブ
B.17	トリアラート
B.18	ベンスルフロン-メチル
B.19	ビスピリバク-ナトリウム
B.20	クロランスラム
B.21	クロルスルフロン
B.22	クロリムロン
B.23	シクロスルファミロン
B.24	ジクロスラム
B.25	フロラスラム
B.26	フルメツラム
B.27	フルピルスルフロン-メチル-ナトリウム
B.28	ホラムスルフロン
B.29	イマザモックス
B.30	イマザピック
B.31	イマザピル
B.32	イマザキン
B.33	イマゼタピル
B.34	イマゾスルフロン

	除草剤 B
B.35	ヨードスルフロン-メチル-ナトリウム
B.36	メソスルフロン
B.37	メタゾスルフロン
B.38	メトスルフロン
B.39	メトスラム
B.40	ニコスルフロン
B.41	ペノキススラム
B.42	プロポキシカルバゾン-ナトリウム
B.43	ピラゾスルフロン-エチル
B.44	ピリベンゾキシム
B.45	ピリフタリド
B.46	ピロキススラム
B.47	リムスルフロン
B.48	スルホスルフロン
B.49	チエンカルバゾン-メチル
B.50	チフェンスルフロン
B.51	トリベヌロン
B.52	トリトスルフロン
B.53	アメトリン
B.54	アトラジン
B.55	ベンタゾン
B.56	プロモキシニル
B.57	ジウロン
B.58	フルオメツロン
B.59	ヘキサジノン
B.60	イソプロツロン
B.61	リヌロン
B.62	メタミトロン
B.63	メトリブジン
B.64	プロバニル
B.65	シマジン
B.66	テルブチラジン
B.67	テルブトリン
B.68	パラコート-ジクロリド
B.69	アシフルオルフェン

10

20

30

40

	除草剤 B
B.70	ブタフェナシル
B.71	カルフェントラゾン-エチル
B.72	フルミオキサジン
B.73	ホメサフェン
B.74	オキサジアルギル
B.75	オキシフルオルフェン
B.76	サフルフェナシル
B.77	スルフエントラゾン
B.78	エチル [3-[2-クロロ-4-フルオロ-5-(1-メチル-6-トリフルオロメチル-2,4-ジオキソ-1,2,3,4-テトラヒドロピリミジン-3-イル)フェノキシ]-2-ピリジルオキシ]アセテート (CAS 353292-31-6)
B.79	3-[7-フルオロ-3-オキソ-4-(プロパ-2-イン-イル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]-オキサジン-6-イル]-1,5-ジメチル-6-チオキソ-[1,3,5]トリアジナン-2,4-ジオン
B.80	1,5-ジメチル-6-チオキソ-3-(2,2,7-トリフルオロ-3-オキソ-4-(プロパ-2-イニル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-6-イル)-1,3,5-トリアジナン-2,4-ジオン
B.81	2-(2,2,7-トリフルオロ-3-オキソ-4-プロパ-2-イニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-イソインドール-1,3-ジオン
B.82	1-メチル-6-トリフルオロメチル-3-(2,2,7-トリフルオロ-3-オキソ-4-プロパ-2-イニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-1H-ピリミジン-2,4-ジオン
B.83	ベンゾピシクロン
B.84	クロマゾン
B.85	ジフルフェニカン
B.86	フルロクロリドン
B.87	イソキサフルトール
B.88	メソトリオン
B.89	ノルフルラゾン
B.90	ピコリナフェン

	除草剤 B
B.91	スルコトリオン
B.92	テフリルトリオン
B.93	テンボトリオン
B.94	トプラメゾン
B.95	ビシクロピロン
B.96	アミトロール
B.97	フルオメツロン
B.98	グリホサート
B.99	グリホサート-イソプロピルアンモニウム
B.100	グリホサート-トリメシウム (スルホサート)
B.101	グルホシナート
B.102	グルホシナート-P
B.103	グルホシナート-アンモニウム
B.104	ペンジメタリン
B.105	トリフルラリン
B.106	アセトクロル
B.107	ブタクロル
B.108	カフェンストロール
B.109	ジメテンアミド-P
B.110	フェントラズアミド
B.111	フルフェナセット
B.112	メフェナセット
B.113	メタザクロル
B.114	メトラクロル
B.115	S-メトラクロル
B.116	プレチラクロル
B.117	フェノキサスルホン
B.118	イソキサベン
B.119	ピロキサスルホン
B.120	2,4-D
B.121	アミノピラリド
B.122	クロピラリド
B.123	ジカンバ
B.124	フルロキシピル-メプチル
B.125	MCPA
B.126	キンクロラク
B.127	キンメラク
B.128	アミノシクロピラクロル
B.129	ジフルフェンゾピル
B.130	ジフルフェンゾピル-ナトリウム

10

20

30

40

	除草剤 B
B.131	ジムロン
B.132	インダノファン
B.133	インダジフラム
B.134	オキサジクロメホン
B.135	トリアジフラム
B.136	II.1
B.137	II.2

	除草剤 B
B.138	II.3
B.139	II.4
B.140	II.5
B.141	II.6
B.142	II.7
B.143	II.8
B.144	II.9

10

【 0 1 8 0 】

に掲載されている除草剤 B . 1 ~ B . 1 4 4 である。

【 0 1 8 1 】

本発明による組成物の、成分 C としての構成成分である、特に好ましいセーフナー C は先に定義されているセーフナー C であるが、特に以下の表 C :

【表 3】

表 C

	セーフナーC
C.1	ベノキサコル
C.2	クロキントセット
C.3	シプロスルファミド
C.4	ジクロルミド
C.5	フェンクロラゾール
C.6	フェンクロリム
C.7	フリラゾール
C.8	イソキサジフェン
C.9	メフェンピル
C.10	ナフタル酸 無水物
C.11	4-(ジクロロアセチル)-1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン(MON4660, CAS 71526-07-3)
C.12	2,2,5-トリメチル-3-(ジクロロアセチル)-1,3-オキサゾリジン(R-29148, CAS 52836-31-4)
C.13	N-(2-メトキシベンゾイル)-4-[(メチルアミノカルボニル)アミノ]ベンゼンスルホンアミド(CAS 129531-12-012-0)

20

30

【 0 1 8 2 】

に掲載されているセーフナー C . 1 ~ C . 1 3 である。

【 0 1 8 3 】

以下に言及する好ましい混合物中の個々の成分の重量比は、先に記載した範囲内(特にはその好ましい範囲内)にある。

【 0 1 8 4 】

特に好ましいのは、定義した式 I のベンゾオキサジノンと表 1 のそれぞれの行に定義されている(各)物質とを含んでいる以下に言及する組成物であり;

非常に好ましいのは、定義した式 I のベンゾオキサジノンと表 1 のそれぞれの行に定義されている(各)物質とを唯一の除草活性化化合物として含んでいる組成物であり;

最も好ましいのは、定義した式 I のベンゾオキサジノンと表 1 のそれぞれの行に定義されている(各)物質とを唯一の活性化化合物として含んでいる組成物である。

【 0 1 8 5 】

40

50

特に好ましいのは、ベンゾオキサジノン I a 4 8 と表 1 のそれぞれの行に定義されている (各) 物質とを含んでいる組成物 1.1 ~ 1.2029 である :

【表 4】

表 1 (組成物 1.1~1.2029):

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.1	B.1	--
1.2	B.2	--
1.3	B.3	--
1.4	B.4	--
1.5	B.5	--
1.6	B.6	--
1.7	B.7	--
1.8	B.8	--
1.9	B.9	--
1.10	B.10	--
1.11	B.11	--
1.12	B.12	--
1.13	B.13	--
1.14	B.14	--
1.15	B.15	--
1.16	B.16	--
1.17	B.17	--
1.18	B.18	--
1.19	B.19	--
1.20	B.20	--

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.21	B.21	--
1.22	B.22	--
1.23	B.23	--
1.24	B.24	--
1.25	B.25	--
1.26	B.26	--
1.27	B.27	--
1.28	B.28	--
1.29	B.29	--
1.30	B.30	--
1.31	B.31	--
1.32	B.32	--
1.33	B.33	--
1.34	B.34	--
1.35	B.35	--
1.36	B.36	--
1.37	B.37	--
1.38	B.38	--
1.39	B.39	--
1.40	B.40	--

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.41	B.41	--
1.42	B.42	--
1.43	B.43	--
1.44	B.44	--
1.45	B.45	--
1.46	B.46	--
1.47	B.47	--
1.48	B.48	--
1.49	B.49	--
1.50	B.50	--
1.51	B.51	--
1.52	B.52	--
1.53	B.53	--
1.54	B.54	--
1.55	B.55	--
1.56	B.56	--
1.57	B.57	--
1.58	B.58	--
1.59	B.59	--
1.60	B.60	--

10

20

30

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.61	B.61	--
1.62	B.62	--
1.63	B.63	--
1.64	B.64	--
1.65	B.65	--
1.66	B.66	--
1.67	B.67	--
1.68	B.68	--
1.69	B.69	--
1.70	B.70	--
1.71	B.71	--
1.72	B.72	--
1.73	B.73	--
1.74	B.74	--
1.75	B.75	--
1.76	B.76	--
1.77	B.77	--
1.78	B.78	--
1.79	B.79	--
1.80	B.80	--
1.81	B.81	--
1.82	B.82	--
1.83	B.83	--
1.84	B.84	--
1.85	B.85	--
1.86	B.86	--
1.87	B.87	--
1.88	B.88	--
1.89	B.89	--
1.90	B.90	--
1.91	B.91	--
1.92	B.92	--
1.93	B.93	--
1.94	B.94	--
1.95	B.95	--
1.96	B.96	--

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.97	B.97	--
1.98	B.98	--
1.99	B.99	--
1.100	B.100	--
1.101	B.101	--
1.102	B.102	--
1.103	B.103	--
1.104	B.104	--
1.105	B.105	--
1.106	B.106	--
1.107	B.107	--
1.108	B.108	--
1.109	B.109	--
1.110	B.110	--
1.111	B.111	--
1.112	B.112	--
1.113	B.113	--
1.114	B.114	--
1.115	B.115	--
1.116	B.116	--
1.117	B.117	--
1.118	B.118	--
1.119	B.119	--
1.120	B.120	--
1.121	B.121	--
1.122	B.122	--
1.123	B.123	--
1.124	B.124	--
1.125	B.125	--
1.126	B.126	--
1.127	B.127	--
1.128	B.128	--
1.129	B.129	--
1.130	B.130	--
1.131	B.131	--
1.132	B.132	--

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.133	B.133	--
1.134	B.134	--
1.135	B.135	--
1.136	B.136	--
1.137	B.137	--
1.138	B.138	--
1.139	B.139	--
1.140	B.140	--
1.141	B.141	--
1.142	B.142	--
1.143	B.143	--
1.144	B.144	--
1.145	B.1	C.1
1.146	B.2	C.1
1.147	B.3	C.1
1.148	B.4	C.1
1.149	B.5	C.1
1.150	B.6	C.1
1.151	B.7	C.1
1.152	B.8	C.1
1.153	B.9	C.1
1.154	B.10	C.1
1.155	B.11	C.1
1.156	B.12	C.1
1.157	B.13	C.1
1.158	B.14	C.1
1.159	B.15	C.1
1.160	B.16	C.1
1.161	B.17	C.1
1.162	B.18	C.1
1.163	B.19	C.1
1.164	B.20	C.1
1.165	B.21	C.1
1.166	B.22	C.1
1.167	B.23	C.1
1.168	B.24	C.1

10

20

30

40

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.169	B.25	C.1
1.170	B.26	C.1
1.171	B.27	C.1
1.172	B.28	C.1
1.173	B.29	C.1
1.174	B.30	C.1
1.175	B.31	C.1
1.176	B.32	C.1
1.177	B.33	C.1
1.178	B.34	C.1
1.179	B.35	C.1
1.180	B.36	C.1
1.181	B.37	C.1
1.182	B.38	C.1
1.183	B.39	C.1
1.184	B.40	C.1
1.185	B.41	C.1
1.186	B.42	C.1
1.187	B.43	C.1
1.188	B.44	C.1
1.189	B.45	C.1
1.190	B.46	C.1
1.191	B.47	C.1
1.192	B.48	C.1
1.193	B.49	C.1
1.194	B.50	C.1
1.195	B.51	C.1
1.196	B.52	C.1
1.197	B.53	C.1
1.198	B.54	C.1
1.199	B.55	C.1
1.200	B.56	C.1
1.201	B.57	C.1
1.202	B.58	C.1
1.203	B.59	C.1
1.204	B.60	C.1

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.205	B.61	C.1
1.206	B.62	C.1
1.207	B.63	C.1
1.208	B.64	C.1
1.209	B.65	C.1
1.210	B.66	C.1
1.211	B.67	C.1
1.212	B.68	C.1
1.213	B.69	C.1
1.214	B.70	C.1
1.215	B.71	C.1
1.216	B.72	C.1
1.217	B.73	C.1
1.218	B.74	C.1
1.219	B.75	C.1
1.220	B.76	C.1
1.221	B.77	C.1
1.222	B.78	C.1
1.223	B.79	C.1
1.224	B.80	C.1
1.225	B.81	C.1
1.226	B.82	C.1
1.227	B.83	C.1
1.228	B.84	C.1
1.229	B.85	C.1
1.230	B.86	C.1
1.231	B.87	C.1
1.232	B.88	C.1
1.233	B.89	C.1
1.234	B.90	C.1
1.235	B.91	C.1
1.236	B.92	C.1
1.237	B.93	C.1
1.238	B.94	C.1
1.239	B.95	C.1
1.240	B.96	C.1

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.241	B.97	C.1
1.242	B.98	C.1
1.243	B.99	C.1
1.244	B.100	C.1
1.245	B.101	C.1
1.246	B.102	C.1
1.247	B.103	C.1
1.248	B.104	C.1
1.249	B.105	C.1
1.250	B.106	C.1
1.251	B.107	C.1
1.252	B.108	C.1
1.253	B.109	C.1
1.254	B.110	C.1
1.255	B.111	C.1
1.256	B.112	C.1
1.257	B.113	C.1
1.258	B.114	C.1
1.259	B.115	C.1
1.260	B.116	C.1
1.261	B.117	C.1
1.262	B.118	C.1
1.263	B.119	C.1
1.264	B.120	C.1
1.265	B.121	C.1
1.266	B.122	C.1
1.267	B.123	C.1
1.268	B.124	C.1
1.269	B.125	C.1
1.270	B.126	C.1
1.271	B.127	C.1
1.272	B.128	C.1
1.273	B.129	C.1
1.274	B.130	C.1
1.275	B.131	C.1
1.276	B.132	C.1

10

20

30

40

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.277	B.133	C.1
1.278	B.134	C.1
1.279	B.135	C.1
1.280	B.136	C.1
1.281	B.137	C.1
1.282	B.138	C.1
1.283	B.139	C.1
1.284	B.140	C.1
1.285	B.141	C.1
1.286	B.142	C.1
1.287	B.143	C.1
1.288	B.144	C.1
1.289	B.1	C.2
1.290	B.2	C.2
1.291	B.3	C.2
1.292	B.4	C.2
1.293	B.5	C.2
1.294	B.6	C.2
1.295	B.7	C.2
1.296	B.8	C.2
1.297	B.9	C.2
1.298	B.10	C.2
1.299	B.11	C.2
1.300	B.12	C.2
1.301	B.13	C.2
1.302	B.14	C.2
1.303	B.15	C.2
1.304	B.16	C.2
1.305	B.17	C.2
1.306	B.18	C.2
1.307	B.19	C.2
1.308	B.20	C.2
1.309	B.21	C.2
1.310	B.22	C.2
1.311	B.23	C.2
1.312	B.24	C.2

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.313	B.25	C.2
1.314	B.26	C.2
1.315	B.27	C.2
1.316	B.28	C.2
1.317	B.29	C.2
1.318	B.30	C.2
1.319	B.31	C.2
1.320	B.32	C.2
1.321	B.33	C.2
1.322	B.34	C.2
1.323	B.35	C.2
1.324	B.36	C.2
1.325	B.37	C.2
1.326	B.38	C.2
1.327	B.39	C.2
1.328	B.40	C.2
1.329	B.41	C.2
1.330	B.42	C.2
1.331	B.43	C.2
1.332	B.44	C.2
1.333	B.45	C.2
1.334	B.46	C.2
1.335	B.47	C.2
1.336	B.48	C.2
1.337	B.49	C.2
1.338	B.50	C.2
1.339	B.51	C.2
1.340	B.52	C.2
1.341	B.53	C.2
1.342	B.54	C.2
1.343	B.55	C.2
1.344	B.56	C.2
1.345	B.57	C.2
1.346	B.58.	C.2
1.347	B.59	C.2
1.348	B.60	C.2

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.349	B.61	C.2
1.350	B.62	C.2
1.351	B.63	C.2
1.352	B.64	C.2
1.353	B.65	C.2
1.354	B.66	C.2
1.355	B.67	C.2
1.356	B.68	C.2
1.357	B.69	C.2
1.358	B.70	C.2
1.359	B.71	C.2
1.360	B.72	C.2
1.361	B.73	C.2
1.362	B.74	C.2
1.363	B.75	C.2
1.364	B.76	C.2
1.365	B.77	C.2
1.366	B.78	C.2
1.367	B.79	C.2
1.368	B.80	C.2
1.369	B.81	C.2
1.370	B.82	C.2
1.371	B.83	C.2
1.372	B.84	C.2
1.373	B.85	C.2
1.374	B.86	C.2
1.375	B.87	C.2
1.376	B.88	C.2
1.377	B.89	C.2
1.378	B.90	C.2
1.379	B.91	C.2
1.380	B.92	C.2
1.381	B.93	C.2
1.382	B.94	C.2
1.383	B.95	C.2
1.384	B.96	C.2

10

20

30

40

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.385	B.97	C.2
1.386	B.98	C.2
1.387	B.99	C.2
1.388	B.100	C.2
1.389	B.101	C.2
1.390	B.102	C.2
1.391	B.103	C.2
1.392	B.104	C.2
1.393	B.105	C.2
1.394	B.106	C.2
1.395	B.107	C.2
1.396	B.108	C.2
1.397	B.109	C.2
1.398	B.110	C.2
1.399	B.111	C.2
1.400	B.112	C.2
1.401	B.113	C.2
1.402	B.114	C.2
1.403	B.115	C.2
1.404	B.116	C.2
1.405	B.117	C.2
1.406	B.118	C.2
1.407	B.119	C.2
1.408	B.120	C.2
1.409	B.121	C.2
1.410	B.122	C.2
1.411	B.123	C.2
1.412	B.124	C.2
1.413	B.125	C.2
1.414	B.126	C.2
1.415	B.127	C.2
1.416	B.128	C.2
1.417	B.129	C.2
1.418	B.130	C.2
1.419	B.131	C.2
1.420	B.132	C.2

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.421	B.133	C.2
1.422	B.134	C.2
1.423	B.135	C.2
1.424	B.136	C.2
1.425	B.137	C.2
1.426	B.138	C.2
1.427	B.139	C.2
1.428	B.140	C.2
1.429	B.141	C.2
1.430	B.142	C.2
1.431	B.143	C.2
1.432	B.144	C.2
1.433	B.1	C.3
1.434	B.2	C.3
1.435	B.3	C.3
1.436	B.4	C.3
1.437	B.5	C.3
1.438	B.6	C.3
1.439	B.7	C.3
1.440	B.8	C.3
1.441	B.9	C.3
1.442	B.10	C.3
1.443	B.11	C.3
1.444	B.12	C.3
1.445	B.13	C.3
1.446	B.14	C.3
1.447	B.15	C.3
1.448	B.16	C.3
1.449	B.17	C.3
1.450	B.18	C.3
1.451	B.19	C.3
1.452	B.20	C.3
1.453	B.21	C.3
1.454	B.22	C.3
1.455	B.23	C.3
1.456	B.24	C.3

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.457	B.25	C.3
1.458	B.26	C.3
1.459	B.27	C.3
1.460	B.28	C.3
1.461	B.29	C.3
1.462	B.30	C.3
1.463	B.31	C.3
1.464	B.32	C.3
1.465	B.33	C.3
1.466	B.34	C.3
1.467	B.35	C.3
1.468	B.36	C.3
1.469	B.37	C.3
1.470	B.38	C.3
1.471	B.39	C.3
1.472	B.40	C.3
1.473	B.41	C.3
1.474	B.42	C.3
1.475	B.43	C.3
1.476	B.44	C.3
1.477	B.45	C.3
1.478	B.46	C.3
1.479	B.47	C.3
1.480	B.48	C.3
1.481	B.49	C.3
1.482	B.50	C.3
1.483	B.51	C.3
1.484	B.52	C.3
1.485	B.53	C.3
1.486	B.54	C.3
1.487	B.55	C.3
1.488	B.56	C.3
1.489	B.57	C.3
1.490	B.58	C.3
1.491	B.59	C.3
1.492	B.60	C.3

10

20

30

40

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.493	B.61	C.3
1.494	B.62	C.3
1.495	B.63	C.3
1.496	B.64	C.3
1.497	B.65	C.3
1.498	B.66	C.3
1.499	B.67	C.3
1.500	B.68	C.3
1.501	B.69	C.3
1.502	B.70	C.3
1.503	B.71	C.3
1.504	B.72	C.3
1.505	B.73	C.3
1.506	B.74	C.3
1.507	B.75	C.3
1.508	B.76	C.3
1.509	B.77	C.3
1.510	B.78	C.3
1.511	B.79	C.3
1.512	B.80	C.3
1.513	B.81	C.3
1.514	B.82	C.3
1.515	B.83	C.3
1.516	B.84	C.3
1.517	B.85	C.3
1.518	B.86	C.3
1.519	B.87	C.3
1.520	B.88	C.3
1.521	B.89	C.3
1.522	B.90	C.3
1.523	B.91	C.3
1.524	B.92	C.3
1.525	B.93	C.3
1.526	B.94	C.3
1.527	B.95	C.3
1.528	B.96	C.3

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.529	B.97	C.3
1.530	B.98	C.3
1.531	B.99	C.3
1.532	B.100	C.3
1.533	B.101	C.3
1.534	B.102	C.3
1.535	B.103	C.3
1.536	B.104	C.3
1.537	B.105	C.3
1.538	B.106	C.3
1.539	B.107	C.3
1.540	B.108	C.3
1.541	B.109	C.3
1.542	B.110	C.3
1.543	B.111	C.3
1.544	B.112	C.3
1.545	B.113	C.3
1.546	B.114	C.3
1.547	B.115	C.3
1.548	B.116	C.3
1.549	B.117	C.3
1.550	B.118	C.3
1.551	B.119	C.3
1.552	B.120	C.3
1.553	B.121	C.3
1.554	B.122	C.3
1.555	B.123	C.3
1.556	B.124	C.3
1.557	B.125	C.3
1.558	B.126	C.3
1.559	B.127	C.3
1.560	B.128	C.3
1.561	B.129	C.3
1.562	B.130	C.3
1.563	B.131	C.3
1.564	B.132	C.3

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.565	B.133	C.3
1.566	B.134	C.3
1.567	B.135	C.3
1.568	B.136	C.3
1.569	B.137	C.3
1.570	B.138	C.3
1.571	B.139	C.3
1.572	B.140	C.3
1.573	B.141	C.3
1.574	B.142	C.3
1.575	B.143	C.3
1.576	B.144	C.3
1.577	B.1	C.4
1.578	B.2	C.4
1.579	B.3	C.4
1.580	B.4	C.4
1.581	B.5	C.4
1.582	B.6	C.4
1.583	B.7	C.4
1.584	B.8	C.4
1.585	B.9	C.4
1.586	B.10	C.4
1.587	B.11	C.4
1.588	B.12	C.4
1.589	B.13	C.4
1.590	B.14	C.4
1.591	B.15	C.4
1.592	B.16	C.4
1.593	B.17	C.4
1.594	B.18	C.4
1.595	B.19	C.4
1.596	B.20	C.4
1.597	B.21	C.4
1.598	B.22	C.4
1.599	B.23	C.4
1.600	B.24	C.4

10

20

30

40

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.601	B.25	C.4
1.602	B.26	C.4
1.603	B.27	C.4
1.604	B.28	C.4
1.605	B.29	C.4
1.606	B.30	C.4
1.607	B.31	C.4
1.608	B.32	C.4
1.609	B.33	C.4
1.610	B.34	C.4
1.611	B.35	C.4
1.612	B.36	C.4
1.613	B.37	C.4
1.614	B.38	C.4
1.615	B.39	C.4
1.616	B.40	C.4
1.617	B.41	C.4
1.618	B.42	C.4
1.619	B.43	C.4
1.620	B.44	C.4
1.621	B.45	C.4
1.622	B.46	C.4
1.623	B.47	C.4
1.624	B.48	C.4
1.625	B.49	C.4
1.626	B.50	C.4
1.627	B.51	C.4
1.628	B.52	C.4
1.629	B.53	C.4
1.630	B.54	C.4
1.631	B.55	C.4
1.632	B.56	C.4
1.633	B.57	C.4
1.634	B.58.	C.4
1.635	B.59	C.4
1.636	B.60	C.4

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.637	B.61	C.4
1.638	B.62	C.4
1.639	B.63	C.4
1.640	B.64	C.4
1.641	B.65	C.4
1.642	B.66	C.4
1.643	B.67	C.4
1.644	B.68	C.4
1.645	B.69	C.4
1.646	B.70	C.4
1.647	B.71	C.4
1.648	B.72	C.4
1.649	B.73	C.4
1.650	B.74	C.4
1.651	B.75	C.4
1.652	B.76	C.4
1.653	B.77	C.4
1.654	B.78	C.4
1.655	B.79	C.4
1.656	B.80	C.4
1.657	B.81	C.4
1.658	B.82	C.4
1.659	B.83	C.4
1.660	B.84	C.4
1.661	B.85	C.4
1.662	B.86	C.4
1.663	B.87	C.4
1.664	B.88	C.4
1.665	B.89	C.4
1.666	B.90	C.4
1.667	B.91	C.4
1.668	B.92	C.4
1.669	B.93	C.4
1.670	B.94	C.4
1.671	B.95	C.4
1.672	B.96	C.4

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.673	B.97	C.4
1.674	B.98	C.4
1.675	B.99	C.4
1.676	B.100	C.4
1.677	B.101	C.4
1.678	B.102	C.4
1.679	B.103	C.4
1.680	B.104	C.4
1.681	B.105	C.4
1.682	B.106	C.4
1.683	B.107	C.4
1.684	B.108	C.4
1.685	B.109	C.4
1.686	B.110	C.4
1.687	B.111	C.4
1.688	B.112	C.4
1.689	B.113	C.4
1.690	B.114	C.4
1.691	B.115	C.4
1.692	B.116	C.4
1.693	B.117	C.4
1.694	B.118	C.4
1.695	B.119	C.4
1.696	B.120	C.4
1.697	B.121	C.4
1.698	B.122	C.4
1.699	B.123	C.4
1.700	B.124	C.4
1.701	B.125	C.4
1.702	B.126	C.4
1.703	B.127	C.4
1.704	B.128	C.4
1.705	B.129	C.4
1.706	B.130	C.4
1.707	B.131	C.4
1.708	B.132	C.4

10

20

30

40

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.709	B.133	C.4
1.710	B.134	C.4
1.711	B.135	C.4
1.712	B.136	C.4
1.713	B.137	C.4
1.714	B.138	C.4
1.715	B.139	C.4
1.716	B.140	C.4
1.717	B.141	C.4
1.718	B.142	C.4
1.719	B.143	C.4
1.720	B.144	C.4
1.721	B.1	C.5
1.722	B.2	C.5
1.723	B.3	C.5
1.724	B.4	C.5
1.725	B.5	C.5
1.726	B.6	C.5
1.727	B.7	C.5
1.728	B.8	C.5
1.729	B.9	C.5
1.730	B.10	C.5
1.731	B.11	C.5
1.732	B.12	C.5
1.733	B.13	C.5
1.734	B.14	C.5
1.735	B.15	C.5
1.736	B.16	C.5
1.737	B.17	C.5
1.738	B.18	C.5
1.739	B.19	C.5
1.740	B.20	C.5
1.741	B.21	C.5
1.742	B.22	C.5
1.743	B.23	C.5
1.744	B.24	C.5

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.745	B.25	C.5
1.746	B.26	C.5
1.747	B.27	C.5
1.748	B.28	C.5
1.749	B.29	C.5
1.750	B.30	C.5
1.751	B.31	C.5
1.752	B.32	C.5
1.753	B.33	C.5
1.754	B.34	C.5
1.755	B.35	C.5
1.756	B.36	C.5
1.757	B.37	C.5
1.758	B.38	C.5
1.759	B.39	C.5
1.760	B.40	C.5
1.761	B.41	C.5
1.762	B.42	C.5
1.763	B.43	C.5
1.764	B.44	C.5
1.765	B.45	C.5
1.766	B.46	C.5
1.767	B.47	C.5
1.768	B.48	C.5
1.769	B.49	C.5
1.770	B.50	C.5
1.771	B.51	C.5
1.772	B.52	C.5
1.773	B.53	C.5
1.774	B.54	C.5
1.775	B.55	C.5
1.776	B.56	C.5
1.777	B.57	C.5
1.778	B.58.	C.5
1.779	B.59	C.5
1.780	B.60	C.5

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.781	B.61	C.5
1.782	B.62	C.5
1.783	B.63	C.5
1.784	B.64	C.5
1.785	B.65	C.5
1.786	B.66	C.5
1.787	B.67	C.5
1.788	B.68	C.5
1.789	B.69	C.5
1.790	B.70	C.5
1.791	B.71	C.5
1.792	B.72	C.5
1.793	B.73	C.5
1.794	B.74	C.5
1.795	B.75	C.5
1.796	B.76	C.5
1.797	B.77	C.5
1.798	B.78	C.5
1.799	B.79	C.5
1.800	B.80	C.5
1.801	B.81	C.5
1.802	B.82	C.5
1.803	B.83	C.5
1.804	B.84	C.5
1.805	B.85	C.5
1.806	B.86	C.5
1.807	B.87	C.5
1.808	B.88	C.5
1.809	B.89	C.5
1.810	B.90	C.5
1.811	B.91	C.5
1.812	B.92	C.5
1.813	B.93	C.5
1.814	B.94	C.5
1.815	B.95	C.5
1.816	B.96	C.5

10

20

30

40

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.817	B.97	C.5
1.818	B.98	C.5
1.819	B.99	C.5
1.820	B.100	C.5
1.821	B.101	C.5
1.822	B.102	C.5
1.823	B.103	C.5
1.824	B.104	C.5
1.825	B.105	C.5
1.826	B.106	C.5
1.827	B.107	C.5
1.828	B.108	C.5
1.829	B.109	C.5
1.830	B.110	C.5
1.831	B.111	C.5
1.832	B.112	C.5
1.833	B.113	C.5
1.834	B.114	C.5
1.835	B.115	C.5
1.836	B.116	C.5
1.837	B.117	C.5
1.838	B.118	C.5
1.839	B.119	C.5
1.840	B.120	C.5
1.841	B.121	C.5
1.842	B.122	C.5
1.843	B.123	C.5
1.844	B.124	C.5
1.845	B.125	C.5
1.846	B.126	C.5
1.847	B.127	C.5
1.848	B.128	C.5
1.849	B.129	C.5
1.850	B.130	C.5
1.851	B.131	C.5
1.852	B.132	C.5

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.853	B.133	C.5
1.854	B.134	C.5
1.855	B.135	C.5
1.856	B.136	C.5
1.857	B.137	C.5
1.858	B.138	C.5
1.859	B.139	C.5
1.860	B.140	C.5
1.861	B.141	C.5
1.862	B.142	C.5
1.863	B.143	C.5
1.864	B.144	C.5
1.865	B.1	C.6
1.866	B.2	C.6
1.867	B.3	C.6
1.868	B.4	C.6
1.869	B.5	C.6
1.870	B.6	C.6
1.871	B.7	C.6
1.872	B.8	C.6
1.873	B.9	C.6
1.874	B.10	C.6
1.875	B.11	C.6
1.876	B.12	C.6
1.877	B.13	C.6
1.878	B.14	C.6
1.879	B.15	C.6
1.880	B.16	C.6
1.881	B.17	C.6
1.882	B.18	C.6
1.883	B.19	C.6
1.884	B.20	C.6
1.885	B.21	C.6
1.886	B.22	C.6
1.887	B.23	C.6
1.888	B.24	C.6

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.889	B.25	C.6
1.890	B.26	C.6
1.891	B.27	C.6
1.892	B.28	C.6
1.893	B.29	C.6
1.894	B.30	C.6
1.895	B.31	C.6
1.896	B.32	C.6
1.897	B.33	C.6
1.898	B.34	C.6
1.899	B.35	C.6
1.900	B.36	C.6
1.901	B.37	C.6
1.902	B.38	C.6
1.903	B.39	C.6
1.904	B.40	C.6
1.905	B.41	C.6
1.906	B.42	C.6
1.907	B.43	C.6
1.908	B.44	C.6
1.909	B.45	C.6
1.910	B.46	C.6
1.911	B.47	C.6
1.912	B.48	C.6
1.913	B.49	C.6
1.914	B.50	C.6
1.915	B.51	C.6
1.916	B.52	C.6
1.917	B.53	C.6
1.918	B.54	C.6
1.919	B.55	C.6
1.920	B.56	C.6
1.921	B.57	C.6
1.922	B.58	C.6
1.923	B.59	C.6
1.924	B.60	C.6

10

20

30

40

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.925	B.61	C.6
1.926	B.62	C.6
1.927	B.63	C.6
1.928	B.64	C.6
1.929	B.65	C.6
1.930	B.66	C.6
1.931	B.67	C.6
1.932	B.68	C.6
1.933	B.69	C.6
1.934	B.70	C.6
1.935	B.71	C.6
1.936	B.72	C.6
1.937	B.73	C.6
1.938	B.74	C.6
1.939	B.75	C.6
1.940	B.76	C.6
1.941	B.77	C.6
1.942	B.78	C.6
1.943	B.79	C.6
1.944	B.80	C.6
1.945	B.81	C.6
1.946	B.82	C.6
1.947	B.83	C.6
1.948	B.84	C.6
1.949	B.85	C.6
1.950	B.86	C.6
1.951	B.87	C.6
1.952	B.88	C.6
1.953	B.89	C.6
1.954	B.90	C.6
1.955	B.91	C.6
1.956	B.92	C.6
1.957	B.93	C.6
1.958	B.94	C.6
1.959	B.95	C.6
1.960	B.96	C.6

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.961	B.97	C.6
1.962	B.98	C.6
1.963	B.99	C.6
1.964	B.100	C.6
1.965	B.101	C.6
1.966	B.102	C.6
1.967	B.103	C.6
1.968	B.104	C.6
1.969	B.105	C.6
1.970	B.106	C.6
1.971	B.107	C.6
1.972	B.108	C.6
1.973	B.109	C.6
1.974	B.110	C.6
1.975	B.111	C.6
1.976	B.112	C.6
1.977	B.113	C.6
1.978	B.114	C.6
1.979	B.115	C.6
1.980	B.116	C.6
1.981	B.117	C.6
1.982	B.118	C.6
1.983	B.119	C.6
1.984	B.120	C.6
1.985	B.121	C.6
1.986	B.122	C.6
1.987	B.123	C.6
1.988	B.124	C.6
1.989	B.125	C.6
1.990	B.126	C.6
1.991	B.127	C.6
1.992	B.128	C.6
1.993	B.129	C.6
1.994	B.130	C.6
1.995	B.131	C.6
1.996	B.132	C.6

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.997	B.133	C.6
1.998	B.134	C.6
1.999	B.135	C.6
1.1000	B.136	C.6
1.1001	B.137	C.6
1.1002	B.138	C.6
1.1003	B.139	C.6
1.1004	B.140	C.6
1.1005	B.141	C.6
1.1006	B.142	C.6
1.1007	B.143	C.6
1.1008	B.144	C.6
1.1009	B.1	C.7
1.1010	B.2	C.7
1.1011	B.3	C.7
1.1012	B.4	C.7
1.1013	B.5	C.7
1.1014	B.6	C.7
1.1015	B.7	C.7
1.1016	B.8	C.7
1.1017	B.9	C.7
1.1018	B.10	C.7
1.1019	B.11	C.7
1.1020	B.12	C.7
1.1021	B.13	C.7
1.1022	B.14	C.7
1.1023	B.15	C.7
1.1024	B.16	C.7
1.1025	B.17	C.7
1.1026	B.18	C.7
1.1027	B.19	C.7
1.1028	B.20	C.7
1.1029	B.21	C.7
1.1030	B.22	C.7
1.1031	B.23	C.7
1.1032	B.24	C.7

10

20

30

40

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.1033	B.25	C.7
1.1034	B.26	C.7
1.1035	B.27	C.7
1.1036	B.28	C.7
1.1037	B.29	C.7
1.1038	B.30	C.7
1.1039	B.31	C.7
1.1040	B.32	C.7
1.1041	B.33	C.7
1.1042	B.34	C.7
1.1043	B.35	C.7
1.1044	B.36	C.7
1.1045	B.37	C.7
1.1046	B.38	C.7
1.1047	B.39	C.7
1.1048	B.40	C.7
1.1049	B.41	C.7
1.1050	B.42	C.7
1.1051	B.43	C.7
1.1052	B.44	C.7
1.1053	B.45	C.7
1.1054	B.46	C.7
1.1055	B.47	C.7
1.1056	B.48	C.7
1.1057	B.49	C.7
1.1058	B.50	C.7
1.1059	B.51	C.7
1.1060	B.52	C.7
1.1061	B.53	C.7
1.1062	B.54	C.7
1.1063	B.55	C.7
1.1064	B.56	C.7
1.1065	B.57	C.7
1.1066	B.58.	C.7
1.1067	B.59	C.7
1.1068	B.60	C.7

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.1069	B.61	C.7
1.1070	B.62	C.7
1.1071	B.63	C.7
1.1072	B.64	C.7
1.1073	B.65	C.7
1.1074	B.66	C.7
1.1075	B.67	C.7
1.1076	B.68	C.7
1.1077	B.69	C.7
1.1078	B.70	C.7
1.1079	B.71	C.7
1.1080	B.72	C.7
1.1081	B.73	C.7
1.1082	B.74	C.7
1.1083	B.75	C.7
1.1084	B.76	C.7
1.1085	B.77	C.7
1.1086	B.78	C.7
1.1087	B.79	C.7
1.1088	B.80	C.7
1.1089	B.81	C.7
1.1090	B.82	C.7
1.1091	B.83	C.7
1.1092	B.84	C.7
1.1093	B.85	C.7
1.1094	B.86	C.7
1.1095	B.87	C.7
1.1096	B.88	C.7
1.1097	B.89	C.7
1.1098	B.90	C.7
1.1099	B.91	C.7
1.1100	B.92	C.7
1.1101	B.93	C.7
1.1102	B.94	C.7
1.1103	B.95	C.7
1.1104	B.96	C.7

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.1105	B.97	C.7
1.1106	B.98	C.7
1.1107	B.99	C.7
1.1108	B.100	C.7
1.1109	B.101	C.7
1.1110	B.102	C.7
1.1111	B.103	C.7
1.1112	B.104	C.7
1.1113	B.105	C.7
1.1114	B.106	C.7
1.1115	B.107	C.7
1.1116	B.108	C.7
1.1117	B.109	C.7
1.1118	B.110	C.7
1.1119	B.111	C.7
1.1120	B.112	C.7
1.1121	B.113	C.7
1.1122	B.114	C.7
1.1123	B.115	C.7
1.1124	B.116	C.7
1.1125	B.117	C.7
1.1126	B.118	C.7
1.1127	B.119	C.7
1.1128	B.120	C.7
1.1129	B.121	C.7
1.1130	B.122	C.7
1.1131	B.123	C.7
1.1132	B.124	C.7
1.1133	B.125	C.7
1.1134	B.126	C.7
1.1135	B.127	C.7
1.1136	B.128	C.7
1.1137	B.129	C.7
1.1138	B.130	C.7
1.1139	B.131	C.7
1.1140	B.132	C.7

10

20

30

40

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.1141	B.133	C.7
1.1142	B.134	C.7
1.1143	B.135	C.7
1.1144	B.136	C.7
1.1145	B.137	C.7
1.1146	B.138	C.7
1.1147	B.139	C.7
1.1148	B.140	C.7
1.1149	B.141	C.7
1.1150	B.142	C.7
1.1151	B.143	C.7
1.1152	B.144	C.7
1.1153	B.1	C.8
1.1154	B.2	C.8
1.1155	B.3	C.8
1.1156	B.4	C.8
1.1157	B.5	C.8
1.1158	B.6	C.8
1.1159	B.7	C.8
1.1160	B.8	C.8
1.1161	B.9	C.8
1.1162	B.10	C.8
1.1163	B.11	C.8
1.1164	B.12	C.8
1.1165	B.13	C.8
1.1166	B.14	C.8
1.1167	B.15	C.8
1.1168	B.16	C.8
1.1169	B.17	C.8
1.1170	B.18	C.8
1.1171	B.19	C.8
1.1172	B.20	C.8
1.1173	B.21	C.8
1.1174	B.22	C.8
1.1175	B.23	C.8
1.1176	B.24	C.8

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.1177	B.25	C.8
1.1178	B.26	C.8
1.1179	B.27	C.8
1.1180	B.28	C.8
1.1181	B.29	C.8
1.1182	B.30	C.8
1.1183	B.31	C.8
1.1184	B.32	C.8
1.1185	B.33	C.8
1.1186	B.34	C.8
1.1187	B.35	C.8
1.1188	B.36	C.8
1.1189	B.37	C.8
1.1190	B.38	C.8
1.1191	B.39	C.8
1.1192	B.40	C.8
1.1193	B.41	C.8
1.1194	B.42	C.8
1.1195	B.43	C.8
1.1196	B.44	C.8
1.1197	B.45	C.8
1.1198	B.46	C.8
1.1199	B.47	C.8
1.1200	B.48	C.8
1.1201	B.49	C.8
1.1202	B.50	C.8
1.1203	B.51	C.8
1.1204	B.52	C.8
1.1205	B.53	C.8
1.1206	B.54	C.8
1.1207	B.55	C.8
1.1208	B.56	C.8
1.1209	B.57	C.8
1.1210	B.58	C.8
1.1211	B.59	C.8
1.1212	B.60	C.8

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.1213	B.61	C.8
1.1214	B.62	C.8
1.1215	B.63	C.8
1.1216	B.64	C.8
1.1217	B.65	C.8
1.1218	B.66	C.8
1.1219	B.67	C.8
1.1220	B.68	C.8
1.1221	B.69	C.8
1.1222	B.70	C.8
1.1223	B.71	C.8
1.1224	B.72	C.8
1.1225	B.73	C.8
1.1226	B.74	C.8
1.1227	B.75	C.8
1.1228	B.76	C.8
1.1229	B.77	C.8
1.1230	B.78	C.8
1.1231	B.79	C.8
1.1232	B.80	C.8
1.1233	B.81	C.8
1.1234	B.82	C.8
1.1235	B.83	C.8
1.1236	B.84	C.8
1.1237	B.85	C.8
1.1238	B.86	C.8
1.1239	B.87	C.8
1.1240	B.88	C.8
1.1241	B.89	C.8
1.1242	B.90	C.8
1.1243	B.91	C.8
1.1244	B.92	C.8
1.1245	B.93	C.8
1.1246	B.94	C.8
1.1247	B.95	C.8
1.1248	B.96	C.8

10

20

30

40

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.1249	B.97	C.8
1.1250	B.98	C.8
1.1251	B.99	C.8
1.1252	B.100	C.8
1.1253	B.101	C.8
1.1254	B.102	C.8
1.1255	B.103	C.8
1.1256	B.104	C.8
1.1257	B.105	C.8
1.1258	B.106	C.8
1.1259	B.107	C.8
1.1260	B.108	C.8
1.1261	B.109	C.8
1.1262	B.110	C.8
1.1263	B.111	C.8
1.1264	B.112	C.8
1.1265	B.113	C.8
1.1266	B.114	C.8
1.1267	B.115	C.8
1.1268	B.116	C.8
1.1269	B.117	C.8
1.1270	B.118	C.8
1.1271	B.119	C.8
1.1272	B.120	C.8
1.1273	B.121	C.8
1.1274	B.122	C.8
1.1275	B.123	C.8
1.1276	B.124	C.8
1.1277	B.125	C.8
1.1278	B.126	C.8
1.1279	B.127	C.8
1.1280	B.128	C.8
1.1281	B.129	C.8
1.1282	B.130	C.8
1.1283	B.131	C.8
1.1284	B.132	C.8

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.1285	B.133	C.8
1.1286	B.134	C.8
1.1287	B.135	C.8
1.1288	B.136	C.8
1.1289	B.137	C.8
1.1290	B.138	C.8
1.1291	B.139	C.8
1.1292	B.140	C.8
1.1293	B.141	C.8
1.1294	B.142	C.8
1.1295	B.143	C.8
1.1296	B.144	C.8
1.1297	B.1	C.9
1.1298	B.2	C.9
1.1299	B.3	C.9
1.1300	B.4	C.9
1.1301	B.5	C.9
1.1302	B.6	C.9
1.1303	B.7	C.9
1.1304	B.8	C.9
1.1305	B.9	C.9
1.1306	B.10	C.9
1.1307	B.11	C.9
1.1308	B.12	C.9
1.1309	B.13	C.9
1.1310	B.14	C.9
1.1311	B.15	C.9
1.1312	B.16	C.9
1.1313	B.17	C.9
1.1314	B.18	C.9
1.1315	B.19	C.9
1.1316	B.20	C.9
1.1317	B.21	C.9
1.1318	B.22	C.9
1.1319	B.23	C.9
1.1320	B.24	C.9

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.1321	B.25	C.9
1.1322	B.26	C.9
1.1323	B.27	C.9
1.1324	B.28	C.9
1.1325	B.29	C.9
1.1326	B.30	C.9
1.1327	B.31	C.9
1.1328	B.32	C.9
1.1329	B.33	C.9
1.1330	B.34	C.9
1.1331	B.35	C.9
1.1332	B.36	C.9
1.1333	B.37	C.9
1.1334	B.38	C.9
1.1335	B.39	C.9
1.1336	B.40	C.9
1.1337	B.41	C.9
1.1338	B.42	C.9
1.1339	B.43	C.9
1.1340	B.44	C.9
1.1341	B.45	C.9
1.1342	B.46	C.9
1.1343	B.47	C.9
1.1344	B.48	C.9
1.1345	B.49	C.9
1.1346	B.50	C.9
1.1347	B.51	C.9
1.1348	B.52	C.9
1.1349	B.53	C.9
1.1350	B.54	C.9
1.1351	B.55	C.9
1.1352	B.56	C.9
1.1353	B.57	C.9
1.1354	B.58	C.9
1.1355	B.59	C.9
1.1356	B.60	C.9

10

20

30

40

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.1357	B.61	C.9
1.1358	B.62	C.9
1.1359	B.63	C.9
1.1360	B.64	C.9
1.1361	B.65	C.9
1.1362	B.66	C.9
1.1363	B.67	C.9
1.1364	B.68	C.9
1.1365	B.69	C.9
1.1366	B.70	C.9
1.1367	B.71	C.9
1.1368	B.72	C.9
1.1369	B.73	C.9
1.1370	B.74	C.9
1.1371	B.75	C.9
1.1372	B.76	C.9
1.1373	B.77	C.9
1.1374	B.78	C.9
1.1375	B.79	C.9
1.1376	B.80	C.9
1.1377	B.81	C.9
1.1378	B.82	C.9
1.1379	B.83	C.9
1.1380	B.84	C.9
1.1381	B.85	C.9
1.1382	B.86	C.9
1.1383	B.87	C.9
1.1384	B.88	C.9
1.1385	B.89	C.9
1.1386	B.90	C.9
1.1387	B.91	C.9
1.1388	B.92	C.9
1.1389	B.93	C.9
1.1390	B.94	C.9
1.1391	B.95	C.9
1.1392	B.96	C.9

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.1393	B.97	C.9
1.1394	B.98	C.9
1.1395	B.99	C.9
1.1396	B.100	C.9
1.1397	B.101	C.9
1.1398	B.102	C.9
1.1399	B.103	C.9
1.1400	B.104	C.9
1.1401	B.105	C.9
1.1402	B.106	C.9
1.1403	B.107	C.9
1.1404	B.108	C.9
1.1405	B.109	C.9
1.1406	B.110	C.9
1.1407	B.111	C.9
1.1408	B.112	C.9
1.1409	B.113	C.9
1.1410	B.114	C.9
1.1411	B.115	C.9
1.1412	B.116	C.9
1.1413	B.117	C.9
1.1414	B.118	C.9
1.1415	B.119	C.9
1.1416	B.120	C.9
1.1417	B.121	C.9
1.1418	B.122	C.9
1.1419	B.123	C.9
1.1420	B.124	C.9
1.1421	B.125	C.9
1.1422	B.126	C.9
1.1423	B.127	C.9
1.1424	B.128	C.9
1.1425	B.129	C.9
1.1426	B.130	C.9
1.1427	B.131	C.9
1.1428	B.132	C.9

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.1429	B.133	C.9
1.1430	B.134	C.9
1.1431	B.135	C.9
1.1432	B.136	C.9
1.1433	B.137	C.9
1.1434	B.138	C.9
1.1435	B.139	C.9
1.1436	B.140	C.9
1.1437	B.141	C.9
1.1438	B.142	C.9
1.1439	B.143	C.9
1.1440	B.144	C.9
1.1441	B.1	C.10
1.1442	B.2	C.10
1.1443	B.3	C.10
1.1444	B.4	C.10
1.1445	B.5	C.10
1.1446	B.6	C.10
1.1447	B.7	C.10
1.1448	B.8	C.10
1.1449	B.9	C.10
1.1450	B.10	C.10
1.1451	B.11	C.10
1.1452	B.12	C.10
1.1453	B.13	C.10
1.1454	B.14	C.10
1.1455	B.15	C.10
1.1456	B.16	C.10
1.1457	B.17	C.10
1.1458	B.18	C.10
1.1459	B.19	C.10
1.1460	B.20	C.10
1.1461	B.21	C.10
1.1462	B.22	C.10
1.1463	B.23	C.10
1.1464	B.24	C.10

10

20

30

40

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.1465	B.25	C.10
1.1466	B.26	C.10
1.1467	B.27	C.10
1.1468	B.28	C.10
1.1469	B.29	C.10
1.1470	B.30	C.10
1.1471	B.31	C.10
1.1472	B.32	C.10
1.1473	B.33	C.10
1.1474	B.34	C.10
1.1475	B.35	C.10
1.1476	B.36	C.10
1.1477	B.37	C.10
1.1478	B.38	C.10
1.1479	B.39	C.10
1.1480	B.40	C.10
1.1481	B.41	C.10
1.1482	B.42	C.10
1.1483	B.43	C.10
1.1484	B.44	C.10
1.1485	B.45	C.10
1.1486	B.46	C.10
1.1487	B.47	C.10
1.1488	B.48	C.10
1.1489	B.49	C.10
1.1490	B.50	C.10
1.1491	B.51	C.10
1.1492	B.52	C.10
1.1493	B.53	C.10
1.1494	B.54	C.10
1.1495	B.55	C.10
1.1496	B.56	C.10
1.1497	B.57	C.10
1.1498	B.58.	C.10
1.1499	B.59	C.10
1.1500	B.60	C.10

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.1501	B.61	C.10
1.1502	B.62	C.10
1.1503	B.63	C.10
1.1504	B.64	C.10
1.1505	B.65	C.10
1.1506	B.66	C.10
1.1507	B.67	C.10
1.1508	B.68	C.10
1.1509	B.69	C.10
1.1510	B.70	C.10
1.1511	B.71	C.10
1.1512	B.72	C.10
1.1513	B.73	C.10
1.1514	B.74	C.10
1.1515	B.75	C.10
1.1516	B.76	C.10
1.1517	B.77	C.10
1.1518	B.78	C.10
1.1519	B.79	C.10
1.1520	B.80	C.10
1.1521	B.81	C.10
1.1522	B.82	C.10
1.1523	B.83	C.10
1.1524	B.84	C.10
1.1525	B.85	C.10
1.1526	B.86	C.10
1.1527	B.87	C.10
1.1528	B.88	C.10
1.1529	B.89	C.10
1.1530	B.90	C.10
1.1531	B.91	C.10
1.1532	B.92	C.10
1.1533	B.93	C.10
1.1534	B.94	C.10
1.1535	B.95	C.10
1.1536	B.96	C.10

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.1537	B.97	C.10
1.1538	B.98	C.10
1.1539	B.99	C.10
1.1540	B.100	C.10
1.1541	B.101	C.10
1.1542	B.102	C.10
1.1543	B.103	C.10
1.1544	B.104	C.10
1.1545	B.105	C.10
1.1546	B.106	C.10
1.1547	B.107	C.10
1.1548	B.108	C.10
1.1549	B.109	C.10
1.1550	B.110	C.10
1.1551	B.111	C.10
1.1552	B.112	C.10
1.1553	B.113	C.10
1.1554	B.114	C.10
1.1555	B.115	C.10
1.1556	B.116	C.10
1.1557	B.117	C.10
1.1558	B.118	C.10
1.1559	B.119	C.10
1.1560	B.120	C.10
1.1561	B.121	C.10
1.1562	B.122	C.10
1.1563	B.123	C.10
1.1564	B.124	C.10
1.1565	B.125	C.10
1.1566	B.126	C.10
1.1567	B.127	C.10
1.1568	B.128	C.10
1.1569	B.129	C.10
1.1570	B.130	C.10
1.1571	B.131	C.10
1.1572	B.132	C.10

10

20

30

40

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.1573	B.133	C.10
1.1574	B.134	C.10
1.1575	B.135	C.10
1.1576	B.136	C.10
1.1577	B.137	C.10
1.1578	B.138	C.10
1.1579	B.139	C.10
1.1580	B.140	C.10
1.1581	B.141	C.10
1.1582	B.142	C.10
1.1583	B.143	C.10
1.1584	B.144	C.10
1.1585	B.1	C.11
1.1586	B.2	C.11
1.1587	B.3	C.11
1.1588	B.4	C.11
1.1589	B.5	C.11
1.1590	B.6	C.11
1.1591	B.7	C.11
1.1592	B.8	C.11
1.1593	B.9	C.11
1.1594	B.10	C.11
1.1595	B.11	C.11
1.1596	B.12	C.11
1.1597	B.13	C.11
1.1598	B.14	C.11
1.1599	B.15	C.11
1.1600	B.16	C.11
1.1601	B.17	C.11
1.1602	B.18	C.11
1.1603	B.19	C.11
1.1604	B.20	C.11
1.1605	B.21	C.11
1.1606	B.22	C.11
1.1607	B.23	C.11
1.1608	B.24	C.11

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.1609	B.25	C.11
1.1610	B.26	C.11
1.1611	B.27	C.11
1.1612	B.28	C.11
1.1613	B.29	C.11
1.1614	B.30	C.11
1.1615	B.31	C.11
1.1616	B.32	C.11
1.1617	B.33	C.11
1.1618	B.34	C.11
1.1619	B.35	C.11
1.1620	B.36	C.11
1.1621	B.37	C.11
1.1622	B.38	C.11
1.1623	B.39	C.11
1.1624	B.40	C.11
1.1625	B.41	C.11
1.1626	B.42	C.11
1.1627	B.43	C.11
1.1628	B.44	C.11
1.1629	B.45	C.11
1.1630	B.46	C.11
1.1631	B.47	C.11
1.1632	B.48	C.11
1.1633	B.49	C.11
1.1634	B.50	C.11
1.1635	B.51	C.11
1.1636	B.52	C.11
1.1637	B.53	C.11
1.1638	B.54	C.11
1.1639	B.55	C.11
1.1640	B.56	C.11
1.1641	B.57	C.11
1.1642	B.58	C.11
1.1643	B.59	C.11
1.1644	B.60	C.11

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.1645	B.61	C.11
1.1646	B.62	C.11
1.1647	B.63	C.11
1.1648	B.64	C.11
1.1649	B.65	C.11
1.1650	B.66	C.11
1.1651	B.67	C.11
1.1652	B.68	C.11
1.1653	B.69	C.11
1.1654	B.70	C.11
1.1655	B.71	C.11
1.1656	B.72	C.11
1.1657	B.73	C.11
1.1658	B.74	C.11
1.1659	B.75	C.11
1.1660	B.76	C.11
1.1661	B.77	C.11
1.1662	B.78	C.11
1.1663	B.79	C.11
1.1664	B.80	C.11
1.1665	B.81	C.11
1.1666	B.82	C.11
1.1667	B.83	C.11
1.1668	B.84	C.11
1.1669	B.85	C.11
1.1670	B.86	C.11
1.1671	B.87	C.11
1.1672	B.88	C.11
1.1673	B.89	C.11
1.1674	B.90	C.11
1.1675	B.91	C.11
1.1676	B.92	C.11
1.1677	B.93	C.11
1.1678	B.94	C.11
1.1679	B.95	C.11
1.1680	B.96	C.11

10

20

30

40

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.1681	B.97	C.11
1.1682	B.98	C.11
1.1683	B.99	C.11
1.1684	B.100	C.11
1.1685	B.101	C.11
1.1686	B.102	C.11
1.1687	B.103	C.11
1.1688	B.104	C.11
1.1689	B.105	C.11
1.1690	B.106	C.11
1.1691	B.107	C.11
1.1692	B.108	C.11
1.1693	B.109	C.11
1.1694	B.110	C.11
1.1695	B.111	C.11
1.1696	B.112	C.11
1.1697	B.113	C.11
1.1698	B.114	C.11
1.1699	B.115	C.11
1.1700	B.116	C.11
1.1701	B.117	C.11
1.1702	B.118	C.11
1.1703	B.119	C.11
1.1704	B.120	C.11
1.1705	B.121	C.11
1.1706	B.122	C.11
1.1707	B.123	C.11
1.1708	B.124	C.11
1.1709	B.125	C.11
1.1710	B.126	C.11
1.1711	B.127	C.11
1.1712	B.128	C.11
1.1713	B.129	C.11
1.1714	B.130	C.11
1.1715	B.131	C.11
1.1716	B.132	C.11

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.1717	B.133	C.11
1.1718	B.134	C.11
1.1719	B.135	C.11
1.1720	B.136	C.11
1.1721	B.137	C.11
1.1722	B.138	C.11
1.1723	B.139	C.11
1.1724	B.140	C.11
1.1725	B.141	C.11
1.1726	B.142	C.11
1.1727	B.143	C.11
1.1728	B.144	C.11
1.1729	B.1	C.12
1.1730	B.2	C.12
1.1731	B.3	C.12
1.1732	B.4	C.12
1.1733	B.5	C.12
1.1734	B.6	C.12
1.1735	B.7	C.12
1.1736	B.8	C.12
1.1737	B.9	C.12
1.1738	B.10	C.12
1.1739	B.11	C.12
1.1740	B.12	C.12
1.1741	B.13	C.12
1.1742	B.14	C.12
1.1743	B.15	C.12
1.1744	B.16	C.12
1.1745	B.17	C.12
1.1746	B.18	C.12
1.1747	B.19	C.12
1.1748	B.20	C.12
1.1749	B.21	C.12
1.1750	B.22	C.12
1.1751	B.23	C.12
1.1752	B.24	C.12

組成物 番号	除草剤 B	セ-7+ C
1.1753	B.25	C.12
1.1754	B.26	C.12
1.1755	B.27	C.12
1.1756	B.28	C.12
1.1757	B.29	C.12
1.1758	B.30	C.12
1.1759	B.31	C.12
1.1760	B.32	C.12
1.1761	B.33	C.12
1.1762	B.34	C.12
1.1763	B.35	C.12
1.1764	B.36	C.12
1.1765	B.37	C.12
1.1766	B.38	C.12
1.1767	B.39	C.12
1.1768	B.40	C.12
1.1769	B.41	C.12
1.1770	B.42	C.12
1.1771	B.43	C.12
1.1772	B.44	C.12
1.1773	B.45	C.12
1.1774	B.46	C.12
1.1775	B.47	C.12
1.1776	B.48	C.12
1.1777	B.49	C.12
1.1778	B.50	C.12
1.1779	B.51	C.12
1.1780	B.52	C.12
1.1781	B.53	C.12
1.1782	B.54	C.12
1.1783	B.55	C.12
1.1784	B.56	C.12
1.1785	B.57	C.12
1.1786	B.58	C.12
1.1787	B.59	C.12
1.1788	B.60	C.12

10

20

30

40

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.1789	B.61	C.12
1.1790	B.62	C.12
1.1791	B.63	C.12
1.1792	B.64	C.12
1.1793	B.65	C.12
1.1794	B.66	C.12
1.1795	B.67	C.12
1.1796	B.68	C.12
1.1797	B.69	C.12
1.1798	B.70	C.12
1.1799	B.71	C.12
1.1800	B.72	C.12
1.1801	B.73	C.12
1.1802	B.74	C.12
1.1803	B.75	C.12
1.1804	B.76	C.12
1.1805	B.77	C.12
1.1806	B.78	C.12
1.1807	B.79	C.12
1.1808	B.80	C.12
1.1809	B.81	C.12
1.1810	B.82	C.12
1.1811	B.83	C.12
1.1812	B.84	C.12
1.1813	B.85	C.12
1.1814	B.86	C.12
1.1815	B.87	C.12
1.1816	B.88	C.12
1.1817	B.89	C.12
1.1818	B.90	C.12
1.1819	B.91	C.12
1.1820	B.92	C.12
1.1821	B.93	C.12
1.1822	B.94	C.12
1.1823	B.95	C.12
1.1824	B.96	C.12

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.1825	B.97	C.12
1.1826	B.98	C.12
1.1827	B.99	C.12
1.1828	B.100	C.12
1.1829	B.101	C.12
1.1830	B.102	C.12
1.1831	B.103	C.12
1.1832	B.104	C.12
1.1833	B.105	C.12
1.1834	B.106	C.12
1.1835	B.107	C.12
1.1836	B.108	C.12
1.1837	B.109	C.12
1.1838	B.110	C.12
1.1839	B.111	C.12
1.1840	B.112	C.12
1.1841	B.113	C.12
1.1842	B.114	C.12
1.1843	B.115	C.12
1.1844	B.116	C.12
1.1845	B.117	C.12
1.1846	B.118	C.12
1.1847	B.119	C.12
1.1848	B.120	C.12
1.1849	B.121	C.12
1.1850	B.122	C.12
1.1851	B.123	C.12
1.1852	B.124	C.12
1.1853	B.125	C.12
1.1854	B.126	C.12
1.1855	B.127	C.12
1.1856	B.128	C.12
1.1857	B.129	C.12
1.1858	B.130	C.12
1.1859	B.131	C.12
1.1860	B.132	C.12

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.1861	B.133	C.12
1.1862	B.134	C.12
1.1863	B.135	C.12
1.1864	B.136	C.12
1.1865	B.137	C.12
1.1866	B.138	C.12
1.1867	B.139	C.12
1.1868	B.140	C.12
1.1869	B.141	C.12
1.1870	B.142	C.12
1.1871	B.143	C.12
1.1872	B.144	C.12
1.1873	B.1	C.13
1.1874	B.2	C.13
1.1875	B.3	C.13
1.1876	B.4	C.13
1.1877	B.5	C.13
1.1878	B.6	C.13
1.1879	B.7	C.13
1.1880	B.8	C.13
1.1881	B.9	C.13
1.1882	B.10	C.13
1.1883	B.11	C.13
1.1884	B.12	C.13
1.1885	B.13	C.13
1.1886	B.14	C.13
1.1887	B.15	C.13
1.1888	B.16	C.13
1.1889	B.17	C.13
1.1890	B.18	C.13
1.1891	B.19	C.13
1.1892	B.20	C.13
1.1893	B.21	C.13
1.1894	B.22	C.13
1.1895	B.23	C.13
1.1896	B.24	C.13

10

20

30

40

組成物 番号	除草剤 B	ε-7+ C
1.1897	B.25	C.13
1.1898	B.26	C.13
1.1899	B.27	C.13
1.1900	B.28	C.13
1.1901	B.29	C.13
1.1902	B.30	C.13
1.1903	B.31	C.13
1.1904	B.32	C.13
1.1905	B.33	C.13
1.1906	B.34	C.13
1.1907	B.35	C.13
1.1908	B.36	C.13
1.1909	B.37	C.13
1.1910	B.38	C.13
1.1911	B.39	C.13
1.1912	B.40	C.13
1.1913	B.41	C.13
1.1914	B.42	C.13
1.1915	B.43	C.13
1.1916	B.44	C.13
1.1917	B.45	C.13
1.1918	B.46	C.13
1.1919	B.47	C.13
1.1920	B.48	C.13
1.1921	B.49	C.13
1.1922	B.50	C.13
1.1923	B.51	C.13
1.1924	B.52	C.13
1.1925	B.53	C.13
1.1926	B.54	C.13
1.1927	B.55	C.13
1.1928	B.56	C.13
1.1929	B.57	C.13
1.1930	B.58.	C.13
1.1931	B.59	C.13
1.1932	B.60	C.13

組成物 番号	除草剤 B	ε-7+ C
1.1933	B.61	C.13
1.1934	B.62	C.13
1.1935	B.63	C.13
1.1936	B.64	C.13
1.1937	B.65	C.13
1.1938	B.66	C.13
1.1939	B.67	C.13
1.1940	B.68	C.13
1.1941	B.69	C.13
1.1942	B.70	C.13
1.1943	B.71	C.13
1.1944	B.72	C.13
1.1945	B.73	C.13
1.1946	B.74	C.13
1.1947	B.75	C.13
1.1948	B.76	C.13
1.1949	B.77	C.13
1.1950	B.78	C.13
1.1951	B.79	C.13
1.1952	B.80	C.13
1.1953	B.81	C.13
1.1954	B.82	C.13
1.1955	B.83	C.13
1.1956	B.84	C.13
1.1957	B.85	C.13
1.1958	B.86	C.13
1.1959	B.87	C.13
1.1960	B.88	C.13
1.1961	B.89	C.13
1.1962	B.90	C.13
1.1963	B.91	C.13
1.1964	B.92	C.13
1.1965	B.93	C.13
1.1966	B.94	C.13
1.1967	B.95	C.13
1.1968	B.96	C.13

組成物 番号	除草剤 B	ε-7+ C
1.1969	B.97	C.13
1.1970	B.98	C.13
1.1971	B.99	C.13
1.1972	B.100	C.13
1.1973	B.101	C.13
1.1974	B.102	C.13
1.1975	B.103	C.13
1.1976	B.104	C.13
1.1977	B.105	C.13
1.1978	B.106	C.13
1.1979	B.107	C.13
1.1980	B.108	C.13
1.1981	B.109	C.13
1.1982	B.110	C.13
1.1983	B.111	C.13
1.1984	B.112	C.13
1.1985	B.113	C.13
1.1986	B.114	C.13
1.1987	B.115	C.13
1.1988	B.116	C.13
1.1989	B.117	C.13
1.1990	B.118	C.13
1.1991	B.119	C.13
1.1992	B.120	C.13
1.1993	B.121	C.13
1.1994	B.122	C.13
1.1995	B.123	C.13
1.1996	B.124	C.13
1.1997	B.125	C.13
1.1998	B.126	C.13
1.1999	B.127	C.13
1.2000	B.128	C.13
1.2001	B.129	C.13
1.2002	B.130	C.13
1.2003	B.131	C.13
1.2004	B.132	C.13

10

20

30

40

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.2005	B.133	C.13
1.2006	B.134	C.13
1.2007	B.135	C.13
1.2008	B.136	C.13
1.2009	B.137	C.13
1.2010	B.138	C.13
1.2011	B.139	C.13
1.2012	B.140	C.13
1.2013	B.141	C.13

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.2014	B.142	C.13
1.2015	B.143	C.13
1.2016	B.144	C.13
1.2017	--	C.1
1.2018	--	C.2
1.2019	--	C.3
1.2020	--	C.4
1.2021	--	C.5
1.2022	--	C.6

組成物 番号	除草剤 B	セ-7ナ- C
1.2023	--	C.7
1.2024	--	C.8
1.2025	--	C.9
1.2026	--	C.10
1.2027	--	C.11
1.2028	--	C.12
1.2029	--	C.13

10

【0186】

個別番号が付いたそれぞれの単一組成物は以下の通り解釈される：

例えば組成物 1.777 は、ベンゾオキサジノン Ia 48、ジウロン(B.57)及びフェンクロラゾール(C.5)を含んでいる(表1、項目1.777；並びに表B、項目B.57及び表C、項目C.5を参照)。

20

【0187】

例えば組成物 2.777 は、ベンゾオキサジノン Im 48(以下の組成物 2.1~2.2029の定義を参照)、ジウロン(B.57)及びフェンクロラゾール(C.5)を含んでいる(表1、項目1.777；並びに表B、項目B.57及び表C、項目C.5を参照)。

【0188】

また、対応する組成物 1.1~1.2029とは活性化合物Aとして化合物 Im 48を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 2.1.~2.2029も特に好ましい。

【0189】

また、対応する組成物 1.1~1.2029とは活性化合物Aとして化合物 In 48を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 3.1.~3.2029も特に好ましい。

30

【0190】

また、対応する組成物 1.1~1.2029とは活性化合物Aとして化合物 Io 48を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 4.1.~4.2029も特に好ましい。

【0191】

また、対応する組成物 1.1~1.2029とは活性化合物Aとして化合物 Ip 48を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 5.1.~5.2029も特に好ましい。

【0192】

また、対応する組成物 1.1~1.2029とは活性化合物Aとして化合物 Iq 48を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 6.1.~6.2029も特に好ましい。

40

【0193】

また、対応する組成物 1.1~1.2029とは別の除草剤BとしてさらにB.31を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 7.1.~7.2029も特に好ましい。

【0194】

また、対応する組成物 1.1~1.2029とは別の除草剤BとしてさらにB.32を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 8.1.~8.2029も特に好ましい。

【0195】

また、対応する組成物 1.1~1.2029とは別の除草剤BとしてさらにB.33を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 9.1.~9.2029も特に好ましい。

【0196】

また、対応する組成物 1.1~1.2029とは別の除草剤BとしてさらにB.40を

50

含んでいるという点でのみ異なっている組成物 10.1. ~ 10.2029 も特に好ましい。

【0197】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.44 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 11.1. ~ 11.2029 も特に好ましい。

【0198】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.45 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 12.1. ~ 12.2029 も特に好ましい。

10

【0199】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.52 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 13.1. ~ 13.2029 も特に好ましい。

【0200】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.53 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 14.1. ~ 14.2029 も特に好ましい。

【0201】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.54 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 15.1. ~ 15.2029 も特に好ましい。

20

【0202】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.55 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 16.1. ~ 16.2029 も特に好ましい。

【0203】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.56 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 17.1. ~ 17.2029 も特に好ましい。

30

【0204】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.57 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 18.1. ~ 18.2029 も特に好ましい。

【0205】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.60 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 19.1. ~ 19.2029 も特に好ましい。

【0206】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.65 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 20.1. ~ 20.2029 も特に好ましい。

40

【0207】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.66 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 21.1. ~ 21.2029 も特に好ましい。

【0208】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.69 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 22.1. ~ 22.2029 も特に好ましい。

50

【0209】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.72 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 23.1. ~ 23.2029 も特に好ましい。

【0210】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.73 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 24.1. ~ 24.2029 も特に好ましい。

【0211】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.76 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 25.1. ~ 25.2029 も特に好ましい。

10

【0212】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.77 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 26.1. ~ 26.2029 も特に好ましい。

【0213】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.83 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 27.1. ~ 27.2029 も特に好ましい。

20

【0214】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.84 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 28.1. ~ 28.2029 も特に好ましい。

【0215】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.87 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 29.1. ~ 29.2029 も特に好ましい。

【0216】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.87 及び B.54 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 30.1. ~ 30.2029 も特に好ましい。

30

【0217】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.87 及び B.60 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 31.1. ~ 31.2029 も特に好ましい。

【0218】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.87 及び B.66 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 32.1. ~ 32.2029 も非常に好ましい。

40

【0219】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.88 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 33.1. ~ 33.2029 も特に好ましい。

【0220】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.88 及び B.54 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 34.1. ~ 34.2029 も特に好ましい。

【0221】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.88 及

50

び B . 6 0 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 3 5 . 1 . ~ 3 5 . 2 0 2 9 も特に好ましい。

【 0 2 2 2 】

また、対応する組成物 1 . 1 ~ 1 . 2 0 2 9 とは別の除草剤 B としてさらに B . 8 8 及び B . 6 6 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 3 6 . 1 . ~ 3 6 . 2 0 2 9 も特に好ましい。

【 0 2 2 3 】

また、対応する組成物 1 . 1 ~ 1 . 2 0 2 9 とは別の除草剤 B としてさらに B . 9 0 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 3 7 . 1 . ~ 3 7 . 2 0 2 9 も特に好ましい。

10

【 0 2 2 4 】

また、対応する組成物 1 . 1 ~ 1 . 2 0 2 9 とは別の除草剤 B としてさらに B . 9 1 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 3 8 . 1 . ~ 3 8 . 2 0 2 9 も特に好ましい。

【 0 2 2 5 】

また、対応する組成物 1 . 1 ~ 1 . 2 0 2 9 とは別の除草剤 B としてさらに B . 9 1 及び B . 5 4 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 3 9 . 1 . ~ 3 9 . 2 0 2 9 も特に好ましい。

【 0 2 2 6 】

また、対応する組成物 1 . 1 ~ 1 . 2 0 2 9 とは別の除草剤 B としてさらに B . 9 1 及び B . 6 0 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 4 0 . 1 . ~ 4 0 . 2 0 2 9 も特に好ましい。

20

【 0 2 2 7 】

また、対応する組成物 1 . 1 ~ 1 . 2 0 2 9 とは別の除草剤 B としてさらに B . 9 1 及び B . 6 6 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 4 1 . 1 . ~ 4 1 . 2 0 2 9 も特に好ましい。

【 0 2 2 8 】

また、対応する組成物 1 . 1 ~ 1 . 2 0 2 9 とは別の除草剤 B としてさらに B . 9 3 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 4 2 . 1 . ~ 4 2 . 2 0 2 9 も特に好ましい。

30

【 0 2 2 9 】

また、対応する組成物 1 . 1 ~ 1 . 2 0 2 9 とは別の除草剤 B としてさらに B . 9 4 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 4 3 . 1 . ~ 4 3 . 2 0 2 9 も特に好ましい。

【 0 2 3 0 】

また、対応する組成物 1 . 1 ~ 1 . 2 0 2 9 とは別の除草剤 B としてさらに B . 9 4 及び B . 5 4 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 4 4 . 1 . ~ 4 4 . 2 0 2 9 も特に好ましい。

【 0 2 3 1 】

また、対応する組成物 1 . 1 ~ 1 . 2 0 2 9 とは別の除草剤 B としてさらに B . 9 4 及び B . 6 0 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 4 5 . 1 . ~ 4 5 . 2 0 2 9 も特に好ましい。

40

【 0 2 3 2 】

また、対応する組成物 1 . 1 ~ 1 . 2 0 2 9 とは別の除草剤 B としてさらに B . 9 4 及び B . 6 6 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 4 6 . 1 . ~ 4 6 . 2 0 2 9 も特に好ましい。

【 0 2 3 3 】

また、対応する組成物 1 . 1 ~ 1 . 2 0 2 9 とは別の除草剤 B としてさらに B . 9 8 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 4 7 . 1 . ~ 4 7 . 2 0 2 9 も特に好ましい。

50

【0234】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.98 及び B.54 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 48.1. ~ 48.2029 も特に好ましい。

【0235】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.98 及び B.76 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 49.1. ~ 49.2029 も特に好ましい。

【0236】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.98 及び B.87 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 50.1. ~ 50.2029 も特に好ましい。

10

【0237】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.98 及び B.106 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 51.1. ~ 51.2029 も特に好ましい。

【0238】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.98 及び B.88 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 52.1. ~ 52.2029 も特に好ましい。

20

【0239】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.98 及び B.91 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 53.1. ~ 53.2029 も特に好ましい。

【0240】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.98 及び B.94 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 54.1. ~ 54.2029 も特に好ましい。

【0241】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.101 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 55.1. ~ 55.2029 も特に好ましい。

30

【0242】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.104 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 56.1. ~ 56.2029 も特に好ましい。

【0243】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.106 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 57.1. ~ 57.2029 も特に好ましい。

40

【0244】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.109 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 58.1. ~ 58.2029 も特に好ましい。

【0245】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.110 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 59.1. ~ 59.2029 も特に好ましい。

【0246】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.111

50

を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 60.1. ~ 60.2029 も特に好ましい。

【0247】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.113 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 61.1. ~ 61.2029 も特に好ましい。

【0248】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.115 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 62.1. ~ 62.2029 も特に好ましい。

【0249】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.116 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 63.1. ~ 63.2029 も特に好ましい。

【0250】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.120 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 64.1. ~ 64.2029 も特に好ましい。

【0251】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.122 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 65.1. ~ 65.2029 も特に好ましい。

【0252】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.123 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 66.1. ~ 66.2029 も特に好ましい。

【0253】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.125 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 67.1. ~ 67.2029 も特に好ましい。

【0254】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.126 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 68.1. ~ 68.2029 も特に好ましい。

【0255】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.133 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 69.1. ~ 69.2029 も特に好ましい。

【0256】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.2 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 70.1. ~ 70.2029 も特に好ましい。

【0257】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.7 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 71.1. ~ 71.2029 も特に好ましい。

【0258】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.29 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 72.1. ~ 72.2029 も特に好ましい。

10

20

30

40

50

【0259】

また、対応する組成物 1.1 ~ 1.2029 とは別の除草剤 B としてさらに B.30 を含んでいるという点でのみ異なっている組成物 73.1. ~ 73.2029 も特に好ましい。

【0260】

以下、式 I で表されるベンゾオキサジノンの調製を実施例により説明するが、本発明の主題は、記載の実施例に限定されるものではない。

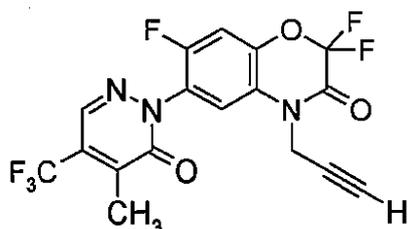
【実施例】

【0261】

実施例 1 :

2, 2, 7 - トリフルオロ - 6 - (5 - メチル - 6 - オキソ - 4 - トリフルオロメチル - 6 H - ピリダジン - 1 - イル) - 4 - プロパ - 2 - イニル - 4 H - ベンゾ [1 , 4] オキサジン - 3 - オン (化合物 I a 4 8)

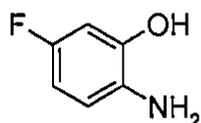
【化 3 0】



【0262】

実施例 1.1 : 2 - アミノ - 5 - フルオロフェノール

【化 3 1】



【0263】

N₂ 雰囲気下にある 5 - フルオロ - 2 - ニトロフェノール (26.63 g、170 mmol) / エタノールにパラジウム / 炭素 (10 wt %、250 mg、0.235 mmol) を加えた。この混合物を H₂ でフラッシュし、H₂ (バルーン) 下の RT で、薄層クロマトグラフィー (TLC) 分析により完全変換となるまで攪拌した。濾過により Pd / C を除去し、濾液を濃縮して 21.6 g の表題化合物を得た。

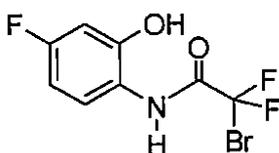
【0264】

¹H NMR (DMSO) : 4.5 (br, 2 H) , 6.35 (dd, 1 H) , 6.45 (dd, 1 H) , 6.50 (dd, 1 H) , 9.5 (br, 1 H) 。

【0265】

実施例 1.2 : 2 - ブロモ - 2, 2 - ジフルオロ - N - (4 - フルオロ - 2 - ヒドロキシフェニル) アセトアミド

【化 3 2】



【0266】

選択肢 a)

0 の 2 - アミノ - 5 - フルオロフェノール (14 g、110 mmol) / 乾燥テトラヒドロフランに水素化ナトリウム (55 wt % / 鉱油 ; 4.81 g、110 mmol) を

10

20

30

40

50

加えた。得られた混合物を -15°C で15分間攪拌した。続いてエチル 2 - プロモ - 2 , 2 - ジフルオロアセテート (24.59 g、121 mmol) を滴下で加え、得られた混合物を 0°C で2時間攪拌した。この反応混合物を飽和 NH_4Cl 水溶液でクエンチし、酢酸エチルで抽出した。合わせた抽出液をブラインで洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、濃縮して33 gの表題化合物を得た。

【0267】

^1H NMR (DMSO) : 3.3 (br, 1H), 6.8 (m, 2H), 7.25 (dd, 1H), 10.4 (br, 1H)。

【0268】

選択肢 b)

0 の2 - アミノ - 5 - フルオロフェノール (200 mg、1.573 mmol) / 乾燥テトラヒドロフランに水素化ナトリウム (55 wt% / 鉱油、68.6 mg、1.573 mmol) を加えた。得られた混合物を -15°C で15分間攪拌した。続いてメチル 2 - プロモ - 2 , 2 - ジフルオロアセテート (327 mg、1.731 mmol) を滴下で加え、得られた混合物を 0°C で2時間攪拌した。この反応混合物を飽和 NH_4Cl 水溶液中にクエンチし、酢酸エチルで抽出した。合わせた抽出液をブラインで洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、濃縮して450 mgの表題化合物を得た。

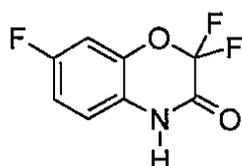
【0269】

^1H NMR (DMSO) : 3.3 (br, 1H), 6.8 (m, 2H), 7.25 (dd, 1H), 10.4 (br, 1H)。

【0270】

実施例 1.3 : 2, 2, 7 - トリフルオロ - 2 H - ベンゾ [b] [1 , 4] オキサジン - 3 (4 H) - オン

【化33】



【0271】

2 - プロモ - 2 , 2 - ジフルオロ - N - (4 - フルオロ - 2 - ヒドロキシフェニル) アセトアミド (33 g、116 mmol) / 乾燥トルエンに1, 8 - ジアザビシクロ [5 . 4 . 0] ウンデカ - 7 - エン (DBU、17.51 ml、116 mmol) を加えた。得られた混合物を一晩 80°C で攪拌した。反応物を飽和 NH_4Cl 水溶液中にクエンチし、酢酸エチルで抽出した。合わせた抽出液をブラインで洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、濃縮して24.94 gの表題化合物を得た。

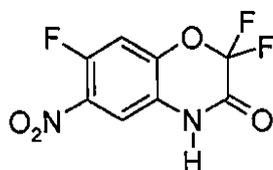
【0272】

GCMS m/e (M+) = 203。

【0273】

実施例 1.4 : 2, 2, 7 - トリフルオロ - 6 - ニトロ - 2 H - ベンゾ [b] [1 , 4] オキサジン - 3 (4 H) - オン

【化34】



【0274】

2, 2, 7 - トリフルオロ - 2 H - ベンゾ [b] [1 , 4] オキサジン - 3 (4 H) - オン (2.5 g、12.31 mmol) を硫酸 (40 ml、750 mmol) に溶解させ

10

20

30

40

50

た。この反応混合物を 0 ~ 5 °C まで冷却させた。硝酸 (1 . 7 6 1 m l 、 3 9 . 7 m m o l) をゆっくり滴下で加え、その温度を 0 ~ 5 °C に維持した。この温度でこの反応混合物を 3 0 分間攪拌した。次いでこの反応混合物を激しく攪拌されている冷水に滴下で加えた。固形物が生成し、これをジクロロメタンで抽出した。合わせた抽出液を Na_2SO_4 で乾燥させ、濃縮して 2 . 5 6 g の表題化合物を褐色の固形物として得た。

【 0 2 7 5 】

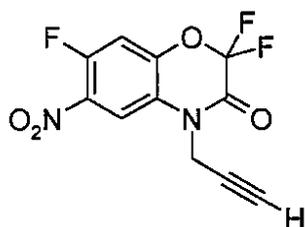
G C / M S m / e (M +) = 2 4 8

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 2 . 9 0 (b r , 1 \text{H}) , 7 . 1 5 (d , 1 \text{H}) , 7 . 8 0 (d , 1 \text{H}) 。

【 0 2 7 6 】

実施例 1 . 5 : 2 , 2 , 7 - トリフルオロ - 6 - ニトロ - 4 - (プロパ - 2 - イニル) - 2 \text{H} ベンゾ [b] [1 , 4] オキサジン - 3 (4 \text{H}) - オン

【 化 3 5 】



10

20

【 0 2 7 7 】

R T にある乾燥 N , N - ジメチルホルムアミド中の 2 , 2 , 7 - トリフルオロ - 6 - ニトロ - 2 \text{H} - ベンゾ [b] [1 , 4] オキサジン - 3 (4 \text{H}) - オン (6 . 9 g 、 2 7 . 8 m m o l) 及び炭酸カリウム (4 . 6 1 g 、 3 3 . 4 m m o l) に 3 - プロモプロパ - 1 - イン (8 0 w t % / トルエン ; 4 . 9 6 g 、 3 3 . 4 m m o l) を滴下で加えた。得られた混合物を R T で一晩攪拌した。この反応混合物を飽和 NH_4Cl 水溶液に注ぎ入れ、酢酸エチルで抽出した。合わせた抽出液を NaCl 水溶液で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、濃縮し、トルエンで追跡して 7 . 0 6 g の表題化合物を暗褐色の固形物として得た。

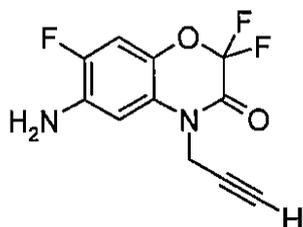
【 0 2 7 8 】

G C M S m / e (M +) = 2 8 6 。

【 0 2 7 9 】

実施例 1 . 6 : 6 - アミノ - 2 , 2 , 7 - トリフルオロ - 4 - (プロパ - 2 - イニル) - 2 \text{H} ベンゾ [b] [1 , 4] オキサジン - 3 (4 \text{H}) - オン

【 化 3 6 】



40

【 0 2 8 0 】

塩化アンモニウム (3 . 9 6 g 、 7 4 . 0 m m o l) / 水に鉄粉 (3 2 5 メッシュ ; 4 . 1 3 g 、 7 4 . 0 m m o l) を加えた。得られた混合物に 2 , 2 , 7 - トリフルオロ - 6 - ニトロ - 4 - (プロパ - 2 - イニル) - 2 \text{H} ベンゾ [b] [1 , 4] オキサジン - 3 (4 \text{H}) - オン (7 . 0 6 g 、 2 4 . 6 7 m m o l) / メタノール + テトラヒドロフランを加えた。得られた混合物を 7 0 °C で 2 時間激しく攪拌した。反応を攪拌下にある水 / 酢酸エチルにクエンチした。得られた 2 相系を濾過し、その相を分離させた。その水相を続いて酢酸エチルで抽出した。合わせた有機相をブラインで洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥さ

50

せ、濃縮して5.15 gの表題化合物を得た。

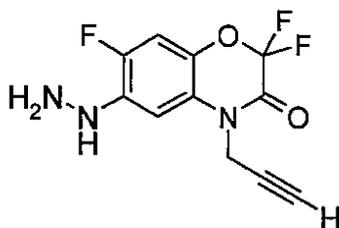
【0281】

GCMS m/e (M^+) = 256。

【0282】

実施例1.7: 2,2,7-トリフルオロ-6-ヒドラジノ-4-プロパ-2-イニル-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オン

【化37】



10

【0283】

-5の6-アミノ-2,2,7-トリフルオロ-4-(プロパ-2-イニル)-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-3(4H)-オン(20g、78mmol)/濃塩酸(100ml、1218mmol)の機械的に攪拌した懸濁液に、亜硝酸ナトリウム(5.82g、84mmol)/水(40ml)の溶液を温度を-5以下に維持して30分かけて滴下で加えた。得られた混合物を-0で1時間攪拌した。その後、攪拌した反応混合物をドライアイス/2-プロパノール冷却浴で-35に冷却した。塩化スズ(II)(37.0g、195mmol)/濃塩酸(40ml、487mmol)の冷却した溶液(-10)を約1分かけて加え、その間に、温度が-35から-10に増加した。得られた混合物を0で1時間攪拌した。その後、80gの珪藻土を反応混合物に加え、得られた混合物を10%NaOH水溶液を攪拌下でゆっくりと加えることによりpH~7に中和した。全体を濾過し、濾過ケーキ及び濾液をジエチルエーテルで2回抽出した。抽出液をブラインで洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、真空濃縮して17gの生成物(約85%の純度を有する)を得た。ジイソプロピルエーテルで粉碎(Trituration)して11.87gの生成物を得た。さらに3.6gの量の生成物を母液を濃縮することにより得た。

20

30

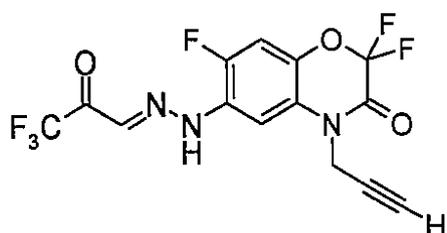
【0284】

1H NMR(DMSO- d_4) 7.29-7.26(m, 2H), 4.80-4.79(d, 2H), 4.16(s, 2H), 3.45-3.44(t, 1H)。

【0285】

実施例1.8: (E)-2,2,7-トリフルオロ-4-プロパ-2-イニル-6-{N'-[3,3,3-トリフルオロ-2-オキソ-プロパ-(Z)-イリデン]-ヒドラジノ}-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オン

【化38】



40

【0286】

酢酸ナトリウム(0.865g、10.55mmol)/水(10ml)の攪拌溶液に、3,3-ジブromo-1,1,1-トリフルオロプロパン-2-オン(1.294g、4.79mmol)を氷冷下、窒素雰囲気下で加えた。その後、反応を80で1時間続けた。その後、反応混合物を0に冷却し、2,2,7-トリフルオロ-6-ヒドラジニル

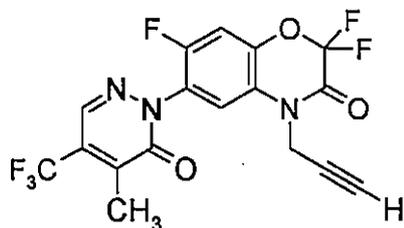
50

- 4 - (プロパ - 2 - イニル) - 2 H - ベンゾ [b] [1 , 4] オキサジン - 3 (4 H)
- オン (1 g、 3 . 6 9 m m o l) を一度に加えた。反応混合物は白色 / ベージュの懸濁液から固い黄色の懸濁液に変化した。反応を室温で 2 時間続け、得られた沈殿物をガラス製濾過器で回収した。生成物 (黄色粉末) を水及びヘプタンで洗浄し、濾過器で乾燥させた。生成物をさらに精製することなく以下のステップで使用した。

【 0 2 8 7 】

実施例 1 . 9 : 2 , 2 , 7 - トリフルオロ - 6 - (5 - メチル - 6 - オキソ - 4 - トリフルオロメチル - 6 H - ピリダジン - 1 - イル) - 4 - プロパ - 2 - イニル - 4 H - ベンゾ [1 , 4] オキサジン - 3 - オン

【 化 3 9 】



10

【 0 2 8 8 】

(E) - 2 , 2 , 7 - トリフルオロ - 4 - (プロパ - 2 - イニル) - 6 - (2 - (3 , 3 , 3 - トリフルオロ - 2 - オキソプロピリデン) ヒドラジニル) - 2 H - ベンゾ [b] [1 , 4] オキサジン - 3 - オン (1 3 9 9 m g、 3 . 6 9 m m o l) / 乾燥トルエン (2 0 m l) の攪拌された黄色の懸濁液に、(カルボエトキシエチリデン)トリフェニルホスホラン (1 7 3 8 m g、 4 . 8 0 m m o l) を加え、透明のオレンジ色 / 赤色の溶液が得られた。反応を、共沸脱水を実施しながら還流で Dean - S t a r k 条件下で一晩続けた。その後、反応混合物を真空で濃縮して約 5 0 % のトリフェニルホスフィンオキドを含有する 2 . 9 9 g の粗生成物を得た。粗生成物をシリカでクロマトグラフィーを実施して (9 : 1 - > 1 : 1 ヘプタン / 酢酸エチル) 1 . 0 8 g の生成物 (約 8 9 % の純度) を得た。ジイソプロピルエーテル / ヘプタンからの再結晶により表題化合物を白色粉末として得た (純度 > 9 9 %) 。

20

【 0 2 8 9 】

¹ H NMR (DMSO - d 6) 8 . 3 7 (s , 1 H) , 7 . 8 2 - 7 . 7 8 (m , 2 H) , 4 . 8 2 (d , 2 H) , 3 . 4 7 - 3 . 4 6 (t , 1 H) , 2 . 3 3 (2 , 3 H) 。

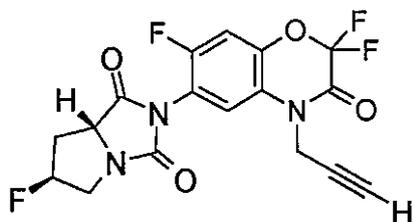
30

【 0 2 9 0 】

実施例 2 :

(6 S , 7 a R) - 6 - フルオロ - 2 - (2 , 2 , 7 - トリフルオロ - 3 - オキソ - 4 - プロパ - 2 - イニル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [1 , 4] オキサジン - 6 - イル) - テトラヒドロ - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 1 , 3 - ジオン

【 化 4 0 】



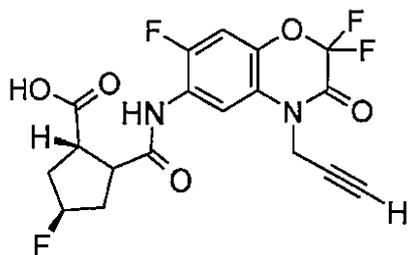
40

【 0 2 9 1 】

実施例 2 . 1 : (1 S , 4 R) - 4 - フルオロ - 2 - (2 , 2 , 7 - トリフルオロ - 3 - オキソ - 4 - プロパ - 2 - イニル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [1 , 4] オキサジン - 6 - イルカルバモイル) - シクロペンタンカルボン酸

50

【化 4 1】



【0292】

10

カルボニルジイミダゾール (1519 mg、9.37 mmol) を無水アセトニトリル (15 ml) 中の 6-アミノ-2,2,7-トリフルオロ-4-(プロパ-2-イニル)-2H-ベンゾ[*b*][1,4]オキサジン-3(4H)-オン (前記のステップ 1.6 の生成物、800 mg、3.12 mmol) 及びトリエチルアミン (0.457 ml、3.28 mmol) の攪拌溶液に室温で窒素下で加えた。得られた混合物を 80 に加熱した。その後、(2*R*, 4*S*)-4-フルオロピロリジン-2-カルボン酸 (416 mg、3.12 mmol) を加えた。得られた懸濁液を還流で攪拌した。2 時間後、赤色/褐色の透明な溶液が得られた。LCMS 分析は完全変換が起こったことを示した。反応混合物を徐々に室温まで冷却し、1*N* 塩酸に注ぎ入れ、酢酸エチルで 3 回抽出した。合わせた有機抽出液をブラインで洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、真空で蒸発させて所望の化合物 (1.34 g、約 90% の純度) を得て、これをさらに精製することなく次のステップで用いた。

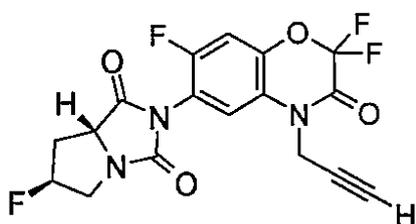
20

【0293】

実施例 2.2: (6*S*, 7*aR*)-6-フルオロ-2-(2,2,7-トリフルオロ-3-オキソ-4-プロパ-2-イニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-テトラヒドロ-ピロロ[1,2-*c*]イミダゾール-1,3-ジオン

【化 4 2】

30



【0294】

ジオキサン (25 ml) 中の (1*S*, 4*R*)-4-フルオロ-2-(2,2,7-トリフルオロ-3-オキソ-4-プロパ-2-イニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)カルバモイル)-シクロペンタンカルボン酸 (1.296 g、3.12 mmol) 及び塩酸 (4*N* 溶液 1.56 ml / ジオキサン、6.24 mmol) の混合物を窒素下で 70 で 2 時間攪拌し、さらに一晩攪拌した後、LCMS 分析は完全変換を示した。反応混合物を室温まで冷却し、真空で蒸発させて約 1.3 g の粗生成物を得た。これをジイソプロピルエーテルで粉碎し、ジクロロメタン及び *n*-ヘプタンの混合物から結晶化させた。固体残渣のカラムクロマトグラフィー (9:1 -> 1:1, *n*-ヘプタン / 酢酸エチル) によって 868 mg の表題化合物 (純度 > 95%) が得られた。

40

【0295】

¹H NMR (CDCl₃) 7.25 - 7.23 (d, 1H), 7.17 - 7.15 (d, 1H), 5.60 - 5.47 (d, 1H, *J* = 5.2), 4.83 - 4.72 (q, 2H), 4.67 - 4.63 (q, 1H), 4.17 (m, 1H), 3.70 - 3.6

50

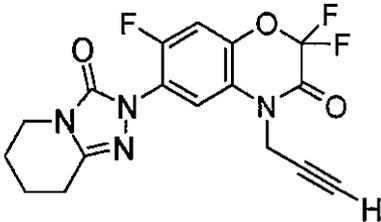
0 (q, 4H), 2.78 - 2.69 (m, 1H), 2.40 - 2.39 (t, 1H), 2.07 - 1.90 (m, 1H)。

【0296】

実施例 3 :

2, 2, 7 - トリフルオロ - 6 - (3 - オキソ - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3 - a] ピリジン - 2 - イル) - 4 - プロパ - 2 - イニル - 4 H - ベンゾ [1, 4] オキサジン - 3 - オン (化合物 Ic 48)

【化 4 3】

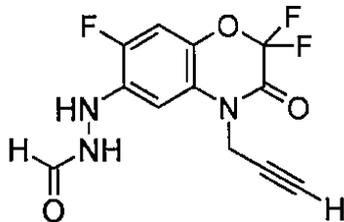


10

【0297】

実施例 3.1 : ギ酸 N' - (2, 2, 7 - トリフルオロ - 3 - オキソ - 4 - プロパ - 2 - イニル - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [1, 4] オキサジン - 6 - イル) - ヒドラジド

【化 4 4】



20

【0298】

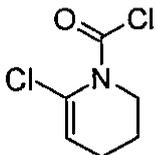
ギ酸 (0.157 ml、4.09 mmol) を 2, 2, 7 - トリフルオロ - 6 - ヒドラジニル - 4 - (プロパ - 2 - イニル) - 2 H - ベンゾ [b] [1, 4] オキサジン - 3 (4 H) - オン (前記のステップ 1.7 の生成物、1.0 g、3.69 mmol) / ジクロロメタンに室温で攪拌しながら加えた。その後、この混合物を一晩室温で攪拌した。得られた沈殿物をガラス製濾過器で単離し、ジイソプロピルエーテルで洗浄して 858 mg の生成物 (> 95 % 純度) を得て、これをさらに精製することなく用いた。

30

【0299】

実施例 3.2 : 6 - クロロ - 3, 4 - ジヒドロピリジン - 1 (2 H) - カルボニルクロリド

【化 4 5】



40

【0300】

攪拌したジホスゲン (3.10 ml、25.7 mmol) に、 -20°C (ドライアイス / 2 - プロパノールバスで冷却した) で、窒素下で活性炭 (0.25 g) を加えると、いくらかのホスゲンガスが遊離した。得られた攪拌混合物にピペリジン - 2 - オン (2.55 g、25.7 mmol) / (モレキュラーシーブで乾燥させた) 酢酸エチル (7 ml) を、温度を 0°C 以下に保ちながら 1 時間かけて非常にゆっくりと滴下で加えた。その後、反応物を室温で 2 時間攪拌すると、TLC 分析によって反応が完結したことが見出された。反応混合物を濾過して沈殿物及び活性炭を取りいた後、乾燥酢酸エチルで洗浄した。

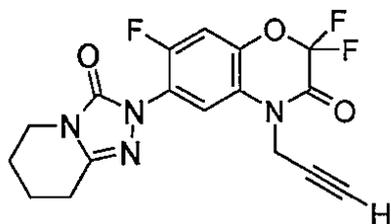
50

濾液を(アルゴンでフラッシュして)真空で濃縮して1.87gの生成物を黄色の曇った油として得て、これをさらに精製することなく次のステップで用いた。

【0301】

実施例3.3: 2,2,7-トリフルオロ-6-(3-オキソ-5,6,7,8-テトラヒドロ-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-2-イル)-4-プロパ-2-イニル-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オン

【化46】



10

【0302】

N'-(2,2,7-トリフルオロ-3-オキソ-4-(プロパ-2-イニル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-6-イル)ホルモヒドラジド(850mg、2.84mmol)/無水アセトニトリル(35ml)の氷浴で冷却した黄色/褐色の懸濁液に、6-クロロ-3,4-ジヒドロピリジン-1(2H)-カルボニルクロリド(614mg、3.41mmol)/無水アセトニトリル(1ml)を、温度を10以下に維持しながら滴下で加えた。その後、トリエチルアミン(0.792ml、5.68mmol)を滴下で加え、~10で1時間撹拌を続け、透明な赤色の溶液を得た。その後、反応物を50で2時間撹拌した後、TLC分析は反応が完結したことを示した。6N塩酸(4.26ml、25.6mmol)を滴下で加え、得られた混合物を50で1時間撹拌した。その後、反応混合物を~250mlの水に注ぎ入れ、全体を酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機相をブラインで洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させた。その後、有機相を真空で濃縮して950mgの粗生成物を得た。クロマトグラフィー(2:1->1:9ヘキサン/酢酸エチル)によって550mgの生成物(92%の純度)が得られた。ジイソプロピルエーテルを用いる粉碎によって440mgの表題化合物(純度>95%)を得た。

20

30

【0303】

¹H NMR(CDCl₃) 7.52-7.50(d, 1H), 7.15-7.13(d, 1H), 4.79-4.78(d, 2H), 3.74-3.71(t, 2H), 2.81-2.78(t, 2H), 2.37-2.36(t, 1H), 2.04-1.95(m, 4H)。

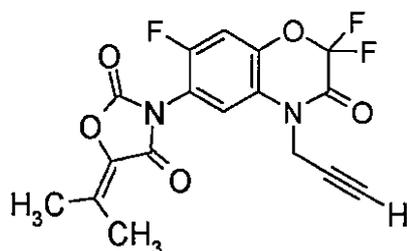
【0304】

実施例4:

5-イソプロピリデン-3-(2,2,7-トリフルオロ-3-オキソ-4-プロパ-2-イニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-オキサゾリジン-2,4-ジオン(化合物Ie48)

40

【化47】

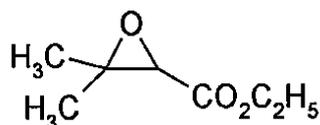


【0305】

50

実施例 4.1: エチル 3,3-ジメチル-オキシラン-2-カルボキシレート

【化 48】



【0306】

乾燥ジエチルエーテル (125 ml) 中のプロパン-2-オン (11.52 ml、157 mmol) 及び 2-クロロ酢酸エチル (25.04 ml、235 mmol) の攪拌溶液に -10 で窒素下で、温度を 5 以下に保ちながらナトリウムエトキシド (10.66 g、157 mmol) を分けて加えた。添加完了後、混合物を 2 時間 -10 で攪拌した後、反応を室温で 3 時間続けた。反応混合物を飽和塩化アンモニウム水溶液でクエンチし、相を分離させ、水相をジエチルエーテル (100 ml) で抽出した。合わせた有機相を Na_2SO_4 で乾燥させ、真空で蒸発させた。得られた残渣を真空蒸留により精製した。主要留分 (-25 mbar、82 ~ 85、14.3 g) は、6.4 mol% のクロロ酢酸エチルを含有する所望の生成物からなった。これをさらに精製することなく次のステップで用いた。

10

【0307】

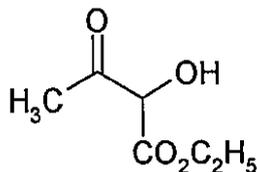
^1H NMR (CDCl_3) 4.32 - 4.20 (m, 2H), 1.43 - 1.39 (d, 6H), 1.33 - 1.30 (t, 3H)。

20

【0308】

実施例 4.2: エチル 2-ヒドロキシ-3-メチルブタ-3-エノアート

【化 49】



【0309】

トス酸一水和物 (0.132 g、0.694 mmol) をロータリーエバポレーター中でベンゼン (3 x 10 ml) との共沸蒸留によって脱水し、窒素でフラッシュした。その後、ベンゼン (100 ml) 及びエチル 3,3-ジメチルオキシラン-2-カルボキシレート (1 g、6.94 mmol) を加え、得られた混合物を還流 (81) で一晩攪拌した。その後、透明な反応混合物を室温に冷却し、4 に 2、3 時間冷却した後、ガラス製濾過器で濾過して結晶化したトス酸を除去した。濾液を真空で (40、50 mbar) 濃縮して、778 mg の粗生成物 (2.5 wt% のベンゼンを含有する) を得て、これをさらに精製することなく次のステップで用いた。

30

【0310】

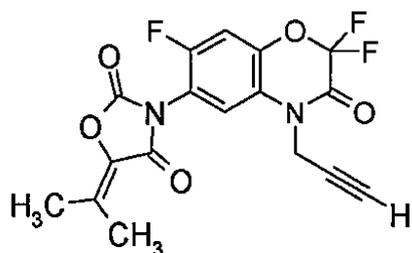
^1H NMR (CDCl_3) 5.14 (d, 1H), 5.04 (s, 1H), 4.56 (s, 1H), 4.30 - 4.24 (q, 2H), 2.51 (br. s, 1H), 1.75 (s, 3H), 1.32 - 1.29 (t, 3H)。

40

【0311】

実施例 4.3: 5-イソプロピリデン-3-(2,2,7-トリフルオロ-3-オキソ-4-プロパ-2-イニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-オキサゾリジン-2,4-ジオン

【化50】



【0312】

無水アセトニトリル(20ml)中の6-アミノ-2,2,7-トリフルオロ-4-(プロパ-2-イニル)-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-3(4H)-オン(前記のステップ1.6の生成物、810mg、3.16mmol)及びトリエチルアミン(0.463ml、3.32mmol)の攪拌溶液に窒素下でカルボニルジイミダゾール(1026mg、6.33mmol)を加えた。得られた混合物を60℃に加熱した。その後、エチル2-ヒドロキシ-3-メチルブタ-3-エノアト(456mg、3.16mmol)/乾燥アセトニトリル(1ml)を加えた。反応物を還流に加熱し、全ての出発原料が消費されるまで、反応物をLCMSによってモニターした。その後、反応混合物を酢酸エチルで希釈し、1N塩酸で洗浄した。水相を酢酸エチルで2回抽出し、合わせた有機相をブラインで洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、真空で濃縮して1.34gの粗生成物を得た。カラムクロマトグラフィー(シリカ、9:1->2;1,ヘキサン/酢酸エチル)によって生成物573mg(24%のエチルカルバメート生成物を含む)を得た。ジクロロメタン/n-ヘプタンからの再結晶によって322mgの表題化合物(純度>95%)を得た。

10

20

【0313】

¹H NMR(CDCl₃) 7.30-7.28(d, 1H), 7.21-7.18(d, 1H), 4.79-4.78(d, 2H), 2.40-2.39(t, 1H), 2.32(s, 3H), 2.09(s, 3H)。

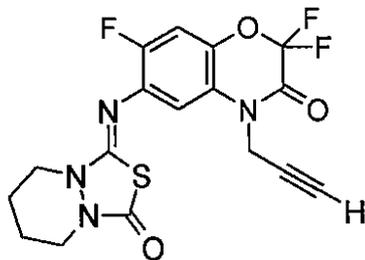
【0314】

実施例5:

7-フルオロ-6-[3-オキソ-テトラヒドロ-[1,3,4]チアジアゾロ[3,4-a]ピリダジン-(1Z)-イリデンアミノ]-4-プロパ-2-イニル-4H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-3-オン(化合物If48)

30

【化51】

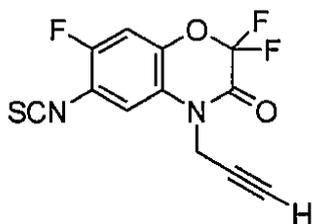


40

【0315】

実施例5.1: 2,2,7-トリフルオロ-6-イソチオシアナト-4-(プロパ-2-イニル)-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-3(4H)-オン

【化52】



【0316】

重炭酸ナトリウム (4.10 g、48.8 mmol) を 6 - アミノ - 2, 2, 7 - トリフルオロ - 4 - (プロパ - 2 - イニル) - 2 H - ベンゾ [b] [1, 4] オキサジン - 3 (4 H) - オン (前記のステップ 1.6 の生成物、5.0 g、19.52 mmol) / 無水エタノール (100 ml) の攪拌溶液に 0 で窒素下で加えた。その後、チオホスゲン (1.795 ml、23.42 mmol) を、反応混合物の温度を 10 以下に保ちながら氷浴冷下で滴下で加えた。添加完了後、反応混合物を 1 時間室温で攪拌し、それまでに、TLC 分析によると反応は完結した。塩を濾過によって除去し、酢酸エチルで洗浄した。濾液を真空で濃縮して 6.55 g の粗生成物 (約 30% のエチルカルバメートを含む) を得た。ジクロロメタンからの再結晶によって 3.84 g の所望の生成物 (> 90% 純度) を得て、これをさらに精製することなく用いた。

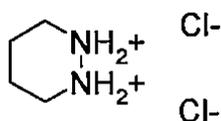
10

【0317】

実施例 5.2 : ピペラジン - 1, 2 - ジイウムクロリド

20

【化53】



【0318】

ジ - tert - ブチルヒドラジン - 1, 2 - ジカルボキシレート (10 g、43.1 mmol) / 乾燥 N, N - ジメチルホルムアミド (25 ml) の溶液を水素化ナトリウム (鉱油中の 60% 懸濁液 3.79 g、95 mmol) / 乾燥 N, N - ジメチルホルムアミド (175 ml) の攪拌懸濁液に 0 で窒素下で加えた。反応混合物を 30 分間攪拌した後、1, 4 - ジブロモブタン (9.3 g、43.1 mmol) を 30 秒以内に加えた。反応物を室温で一晩攪拌した。その後、水 (~ 20 ml) を反応混合物に室温でゆっくりと加え、攪拌を約 5 分間続けた。その後、クエンチした反応混合物を 1 リットルの水に注ぎ入れた。生成物をジエチルエーテル (200 ml) で 2 回抽出し、合わせた有機相を 10% 塩化ナトリウム水溶液で 3 回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、真空で濃縮して 1.4 g の粗テトラヒドロピリダジン - 1, 2 - ジカルボン酸ジ - tert - ブチルエステルを得た。これをジエチルエーテル (200 ml) に溶解させ、4 N 塩酸 (108 ml、431 mmol) / ジオキサンを加えた。得られた混合物を室温で一晩攪拌した。生成した白色の沈殿物を濾過によって単離し、窒素フロー下で乾燥させて 4.6 g の粗生成物を得た。¹H NMR による分析は反応が完結していないことを示した。この粗生成物を同様の調製による粗生成物と合わせ、ジクロロメタン (200 ml) に溶解させ、4 N 塩酸 / ジオキサン (60 ml、240 mmol) で処理し、得られた混合物を室温で一晩攪拌した。反応混合物を真空で濃縮し、乾燥ジエチルエーテルで粉砕した。得られた沈殿物を濾過によって単離し、窒素フロー下で乾燥させて 6.3 g の生成物を得て、これをさらに精製することなく次のステップで用いた。

30

40

【0319】

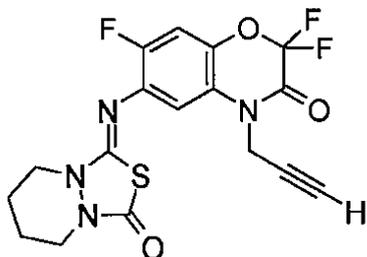
¹H NMR (DMSO - d₄) 8.85 (ブロード s, 4 H), 3.00 (s, 4 H), 1.69 (s, 4 H)。

【0320】

50

実施例 5 . 3 : 7 - フルオロ - 6 - [3 - オキソ - テトラヒドロ - [1 , 3 , 4] チアジアゾロ [3 , 4 - a] ピリダジン - (1 Z) - イリデンアミノ] - 4 - プロパ - 2 - イニル - 4 H - ベンゾ [1 , 4] オキサジン - 3 - オン (化合物 1 f 4 8)

【化 5 4】



10

【0321】

トリエチルアミン (1 . 4 0 2 m l 、 1 0 . 0 6 m m o l) をピペラジン - 1 , 2 - ジイウムクロリド (0 . 5 8 7 g 、 3 . 6 9 m m o l) / ジクロロメタン (5 m l) の攪拌懸濁液に室温で窒素下で加えた。これによって濃白色でほとんど攪拌できない懸濁液を得た。これに、2,2,7-トリフルオロ-6-イソチオシアナト-4-(プロパ-2-イニル)-2H-エンゾ [b] [1 , 4] オキサジン - 3 (4 H) - オン (前記のステップ 4 . 1 の生成物、1 g、3.35 mmol) / ジクロロメタン (5 m l) を滴下で加えた。得られた混合物を室温で1時間攪拌し、それまでに、TLC分析は反応が完結したことを示した。反応混合物を真空で濃縮して粗生成物を得た。その後、水で粉砕して塩を除去した。生成した沈殿物を濾過によって単離し、水で洗浄し、乾燥させて1.19 gの表題化合物を白色粉末として得た (純度 > 9 5 %) 。

20

【0322】

^1H NMR (DMSO - d_4) 10.03 (s , 1 H) , 7.92 - 7.90 (d , 1 H) , 7.55 - 7.52 (d , 1 H) , 5.37 - 5.34 (t , 1 H) , 4.78 (s , 2 H) , 4.15 (ブロード s , 2 H) , 3.45 (s , 1 H) , 2.88 - 2.87 (d , 2 H) , 1.68 - 1.61 (m , 4 H)

MS (m / z) , M + H : 411.0。

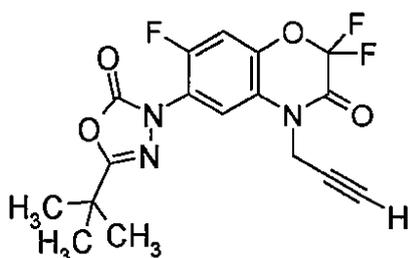
【0323】

実施例 6 :

6 - (5 - tert - ブチル - 2 - オキソ - [1 , 3 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - 2 , 2 , 7 - トリフルオロ - 4 - プロパ - 2 - イニル - 4 H - ベンゾ [1 , 4] オキサジン - 3 - オン (化合物 1 g 4 8)

30

【化 5 5】

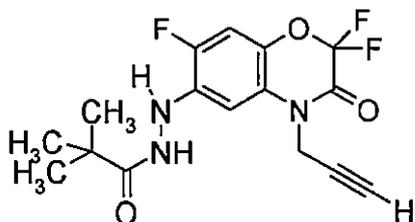


40

【0324】

実施例 6 . 1 : 2 , 2 - ジメチル - プロピオン酸 N ' - (2 , 2 , 7 - トリフルオロ - 3 - オキソ - 4 - プロパ - 2 - イニル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [1 , 4] オキサジン - 6 - イル) - ヒドラジド

【化56】



【0325】

ピバル酸無水物 (0.687 g、3.69 mmol) を 2, 2, 7 - トリフルオロ - 6 - ヒドラジニル - 4 - (プロパ - 2 - イニル) - 2 H - ベンゾ [b] [1, 4] オキサジン - 3 (4 H) - オン (前記のステップ 1.7 の生成物、1.0 g、3.69 mmol) / ジクロロメタンの攪拌溶液に室温で窒素下で滴下で加えた。得られた混合物を室温で 1 時間攪拌し、それまでに、TLC 分析は反応が完結したことを示した。反応混合物をジクロロメタンで希釈し、1 N 塩酸水溶液で洗浄した。水相をジクロロメタンで抽出し、合わせた有機相を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、真空で蒸発させて 1.55 g の粗生成物を得て、これをさらに精製することなく次のステップで用いた。

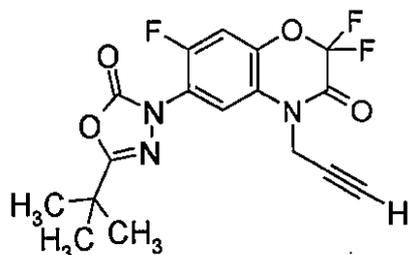
10

【0326】

実施例 6.2: 6 - (5 - tert - ブチル - 2 - オキソ - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - 2, 2, 7 - トリフルオロ - 4 - プロパ - 2 - イニル - 4 H - ベンゾ [1, 4] オキサジン - 3 - オン

20

【化57】



30

【0327】

ジホスゲン (0.445 ml、3.69 mmol) を N' - (2, 2, 7 - トリフルオロ - 3 - オキソ - 4 - (プロパ - 2 - イニル) - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [b] [1, 4] オキサジン - 6 - イル) ピバロヒドラジド (1311 mg、3.69 mmol) / 乾燥トルエン (30 ml) の攪拌溶液に室温で窒素下で滴下で加えた。得られた混合物を還流で 4 時間攪拌した後、室温に冷却し、真空で蒸発させて 1.7 g の粗生成物を得た。これをジイソプロピルエーテルで粉砕して 990 mg の表題化合物を白色粉末として得た (純度 > 95%)。

【0328】

^1H NMR (DMSO - d_6) 7.83 - 7.80 (m, 2H), 4.83 (d, 2H), 3.50 (s, 1H), 1.32 (s, 9H)。

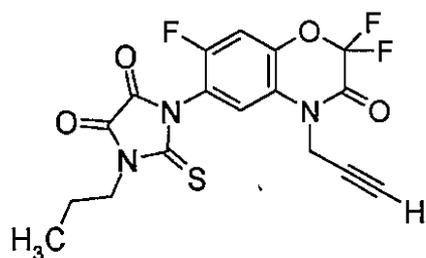
40

【0329】

実施例 7:

1 - プロピル - 2 - チオキソ - 3 - (2, 2, 7 - トリフルオロ - 3 - オキソ - 4 - プロパ - 2 - イニル - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [1, 4] オキサジン - 6 - イル) - イミダゾリジン - 4, 5 - ジオン (化合物 I i 48)

【化58】

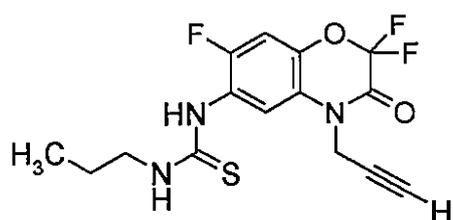


【0330】

10

実施例7.1: 1-プロピル-3-(2,2,7-トリフルオロ-3-オキソ-4-プロパ-2-イニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-チオ尿素

【化59】



20

【0331】

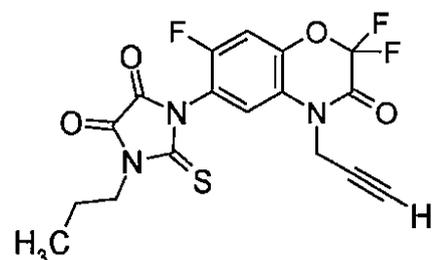
プロパン-1-アミン(0.937 ml、11.74 mmol)を2,2,7-トリフルオロ-6-イソチオシアナト-4-(プロパ-2-イニル)-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-3(4H)-オン(前記のステップ4.1の生成物、1.0 g、3.35 mmol)/ジクロロメタン(10 ml)の攪拌溶液に室温で窒素下で加えた。得られた混合物を室温で1時間攪拌し、それまでに、TLC分析は反応が完結したことを示した。反応混合物を真空で蒸発させて1.3 gの所望の生成物(純度>95%)を得て、これをさらに精製することなく次のステップで用いた。

【0332】

30

実施例7.2: 1-プロピル-2-チオキソ-3-(2,2,7-トリフルオロ-3-オキソ-4-プロパ-2-イニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-イミダゾリジン-4,5-ジオン

【化60】



40

【0333】

エチルオキサリルクロリド(0.487 ml、4.36 mmol)を1-プロピル-3-(2,2,7-トリフルオロ-3-オキソ-4-(プロパ-2-イニル)-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-6-イル)チオ尿素(1.197 mg、3.35 mmol)/ジクロロメタン(20 ml)の攪拌溶液に室温で窒素下で加えた。得られた混合物を室温で一晩攪拌した後、真空で蒸発させた。トルエンを黄色残渣に加え、得られた懸濁液を3時間還流させ、透明な溶液を得た。反応混合物を室温に冷却し、得られた沈殿物を単離し、ヘプタンで洗浄して792 mgの粗生成物を得た。その後、こ

50

れをトルエンから再結晶した。残っている不純物を、固体を酢酸エチルに溶解させ、重炭酸ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、真空で蒸発させることによって除去して667mgの表題化合物(純度>95%)を得た。

【0334】

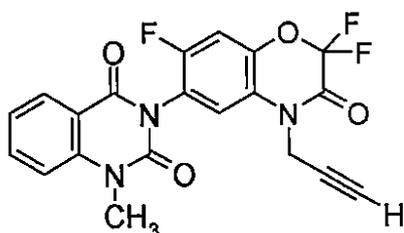
^1H NMR (DMSO- d_6) 7.83 - 7.80 (d, 1H), 7.66 - 7.64 (d, 1H), 4.77 - 4.67 (d, 2H), 3.91 - 3.80 (t, 2H), 3.52 - 3.51 (t, 1H), 1.75 - 1.66 (m, 2H), 0.97 - 0.93 (t, 3H)。

【0335】

実施例8:

1-メチル-3-(2,2,7-トリフルオロ-3-オキソ-4-プロパ-2-イニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-6-イル)-1H-キナゾリン-2,4-ジオン(化合物Ik48)

【化61】



【0336】

カルボニルジイミダゾール(1.266g、7.81mmol)を無水アセトニトリル(20ml)中の6-アミノ-2,2,7-トリフルオロ-4-(プロパ-2-イニル)-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-3(4H)-オン(前記のステップ1.6の生成物、1.0g、3.90mmol)及びトリエチルアミン(0.571ml、4.10mmol)の攪拌溶液に室温で窒素下に加えた。得られた混合物を60℃に加熱した後、メチル2-(メチルアミノ)ベンゾエート(0.602ml、4.10mmol)を加えた。反応物を還流まで1時間加熱し、その後、ベンジルアミンでクエンチした後に酸性水溶液で後処理をした少量のサンプルのLCMS分析は、反応が完結したことを示した。その後、反応混合物を酢酸エチル(100ml)及び1N塩酸水溶液(100ml)の攪拌混合物に注ぎ入れた。相を分離させ、水相を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機相をラインで洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、真空で蒸発させて1.69gの粗生成物を得た。これを、ジクロロメタンで一晩粉碎し、得られた沈殿物を濾過分離し、ジイソプロピルエーテルで洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させて860mgの表題化合物をオフホワイトの粉末として得た。

【0337】

^1H NMR (CDCl $_3$) 8.11 - 8.09 (d, 1H), 7.91 - 7.88 (t, 1H), 7.78 - 7.77 (t, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.41 - 7.37 (t, 1H), 4.80 - 4.71 (d, 2H), 3.58 (s, 3H), 3.45 (s, 1H)。

【0338】

前記の化合物に加えて、別の式Iのベンゾオキサジンを前記の方法に従って調製し、以下の表2に記載した。

【表 5】

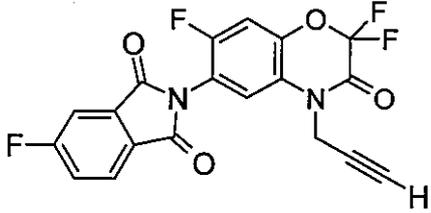
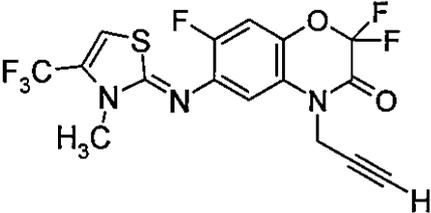
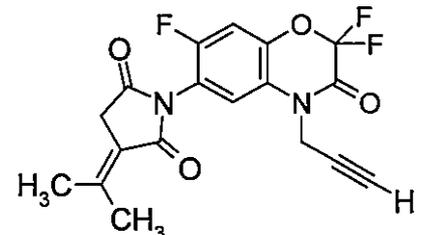
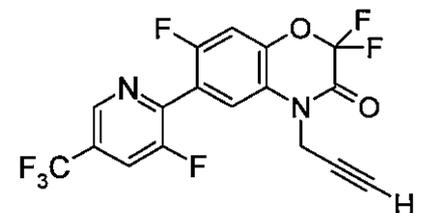
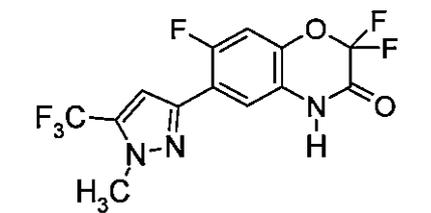
実施例 番号	化合物	¹ H NMR (400 MHz; CDCl ₃) 又は MS (m/z) M+H
9		379.2
10		7.28 (d, 1H); 7.19 (d, 1H); 4.78 (s, 2H); 2.40 (s, 1H); 2.32 (s, 3H); 2.09 (s, 3H)
11		7.44 (d, 1H); 7.16 (d, 1H); 7.07 (t, 1H); 4.79 (s, 2H); 2.39 (s, 1H); 1.59 (s, 3H)
12		389.0
13		409.9
14		367.0

10

20

30

40

実施例番号	化合物	¹ H NMR (400 MHz; CDCl ₃) 又は MS (m/z) M+H
15		8.0 (m, 1H); 7.7 (m, 1H); 7.5 (m, 1H); 7.3 (m, 1H); 7.2 (m, 1H); 4.79 (s, 2H); 2.39 (s, 1H)
16		422.0
17		379.0
18		405.0
19		352.0

10

20

30

40

50

【0339】

使用実施例

式 I で表されるベンゾオキサジノンの除草活性を以下の温室実験により実証した。

【0340】

使用した栽培容器は、基土としておよそ 3 . 0 % の腐葉土を含む砂壤土が入っているプラスチック製フラワーポットであった。試験植物の種子はそれぞれの種で分けて播種した。

【0341】

発芽前処理には、水に懸濁又は乳化させておいた活性成分を、播種の後、微細分散型ノズルを用いて直接施用した。発芽と生長を促進するため容器を緩く灌漑し、そのあと植物が根付くまで透明プラスチック製フードでカバーした。活性成分によってこのカバーが損なわれていない限り、このカバーは試験植物の均一な発芽を引き起こした。

【0342】

発芽後処理には、試験植物を、その草性に応じて、先ず 3 ~ 15 cm の背丈まで生長させ、そうして初めて水に懸濁又は乳化させておいた活性成分で処理した。この目的のため

には、試験植物は、同じ容器内に直接播種し、生長させたか、又は、苗木として最初は別に生長させ、処理の数日前に試験容器に移植した。

【 0 3 4 3 】

種に応じて、植物を 1 0 ~ 2 5 か又は 2 0 ~ 3 5 に保持した。試験期間は、2 ~ 4 週間に及んだ。この間、植物を世話し、そして個々の処理に対するその反応を評価した。

【 0 3 4 4 】

評価は、0 ~ 1 0 0 の尺度を用いて行った。「1 0 0」は、植物の発芽がまったくないか又は少なくともその空中部分が完全に破壊されていることを意味し、そして「0」は、損傷がまったくないか又は正常な生長過程にあることを意味する。優れた除草活性は、少なくとも 7 0 の値で与えられ、非常に優れた除草活性は、少なくとも 8 5 の値で与えられる。

10

【 0 3 4 5 】

この温室実験で使用した植物は、以下の種に属するものであった：

【表 6】

Bayer Code	学名
ABUTH	アブチロン・テオフラステ [Abutilon theophrasti]
AMAPA	アマランツス・パルメリ Amaranthus palmeri
AMARE	アマランツス・レトロフレキス [Amaranthus retroflexus]
CHEAL	ケノポジウム・アルBUM [Chenopodium album]
KCHSC	コキア・スコパリア [Kochia scoparia]
MALNE	マルバ・ネグレクタ [Malva neglecta]
VIOAR	ヴィオラ・アルベンシス [Viola arvensis]

20

【 0 3 4 6 】

1 2 . 5 g / h a の施用量で、発芽後法で施用された化合物 I a 4 8 は、アマランツス・パルメリ、コキア・スコパリア及びマルバ・ネグレクタに対して非常に優れた除草活性を示した。

30

【 0 3 4 7 】

2 5 g / h a の施用量で、発芽前法で施用された化合物 I a 4 8 は、アマランツス・レトロフレキス及びヴィオラ・アルベンシスに対して非常に優れた除草活性を示した。

【 0 3 4 8 】

1 2 . 5 g / h a の施用量で、発芽後法で施用された化合物 I g 4 8 は、アマランツス・パルメリ及びマルバ・ネグレクタに対して非常に優れた除草活性を示し、コキア・スコパリアに対して優れた除草活性を示した。

40

【 0 3 4 9 】

2 5 g / h a の施用量で、発芽前法で施用された化合物 I g 4 8 は、アマランツス・レトロフレキス及びヴィオラ・アルベンシスに対して非常に優れた除草活性を示した。

【 0 3 5 0 】

1 2 . 5 g / h a の施用量で、発芽後法で施用された化合物 I i 4 8 は、コキア・スコパリア及びマルバ・ネグレクタに対して非常に優れた除草活性を示した。

【 0 3 5 1 】

1 2 . 5 g / h a の施用量で、発芽後法で施用された化合物 I k 4 8 は、アマランツス・パルメリ、コキア・スコパリア及びマルバ・ネグレクタに対して非常に優れた除草活性を示した。

50

【 0 3 5 2 】

25 g / ha の施用量で、発芽前法で施用された化合物 I k 4 8 は、アマランツス・レトロフレキススに対して非常に優れた除草活性を示し、ヴィオラ・アルペンシスに対して優れた除草活性を示した。

【0353】

50 g / ha の施用量で、発芽前法で施用された化合物 I f 4 8 は、アブチロン・テオフラステチ、アマランツス・レトロフレキスス及びケノボジウム・アルブムに対して非常に優れた除草活性を示した。

【0354】

50 g / ha の施用量で、発芽前法で施用された実施例 2 の化合物は、アブチロン・テオフラステチ、アマランツス・レトロフレキスス及びケノボジウム・アルブムに対して非常に優れた除草活性を示した。

10

【0355】

50 g / ha の施用量で、発芽前法で施用された実施例 9 の化合物は、アブチロン・テオフラステチ、アマランツス・レトロフレキスス及びケノボジウム・アルブムに対して非常に優れた除草活性を示した。

【0356】

50 g / ha の施用量で、発芽前法で施用された実施例 10 の化合物は、アブチロン・テオフラステチ、アマランツス・レトロフレキスス及びケノボジウム・アルブムに対して非常に優れた除草活性を示した。

【0357】

50 g / ha の施用量で、発芽前法で施用された実施例 11 の化合物は、アブチロン・テオフラステチ、アマランツス・レトロフレキスス及びケノボジウム・アルブムに対して非常に優れた除草活性を示した。

20

【0358】

50 g / ha の施用量で、発芽前法で施用された実施例 12 の化合物は、アブチロン・テオフラステチ、アマランツス・レトロフレキスス及びケノボジウム・アルブムに対して非常に優れた除草活性を示した。

【0359】

50 g / ha の施用量で、発芽前法で施用された実施例 13 の化合物は、アマランツス・レトロフレキスス及びケノボジウム・アルブムに対して非常に優れた除草活性を示した。

30

【0360】

50 g / ha の施用量で、発芽前法で施用された実施例 14 の化合物は、アブチロン・テオフラステチ、アマランツス・レトロフレキスス及びケノボジウム・アルブムに対して非常に優れた除草活性を示した。

【0361】

50 g / ha の施用量で、発芽前法で施用された実施例 15 の化合物は、アマランツス・レトロフレキスス及びケノボジウム・アルブムに対して非常に優れた除草活性を示した。

【0362】

50 g / ha の施用量で、発芽前法で施用された実施例 16 の化合物は、アマランツス・レトロフレキスス及びケノボジウム・アルブムに対して非常に優れた除草活性を示した。

40

【0363】

50 g / ha の施用量で、発芽前法で施用された実施例 17 の化合物は、アマランツス・レトロフレキスス及びケノボジウム・アルブムに対して非常に優れた除草活性を示した。

【0364】

1000 g / ha の施用量で、発芽後法で施用された実施例 19 の化合物は、アブチロン・テオフラステチに対して非常に優れた除草活性を示した。

50

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2011/066628

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER		
INV.	C07D413/04 C07D471/04 C07D487/04 C07D513/04 A01N43/90	
	A01N43/86	
ADD.		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)		
C07D A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)		
EPO-Internal, WPI Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 93/15074 A1 (DU PONT [US]) 5 August 1993 (1993-08-05) 12th entry in; page 79; table 23 Use as herbicide, for control of vegetationclaim 9 Compositionsclaim 8	1-9
X	WO 92/06962 A1 (MONSANTO CO [US]) 30 April 1992 (1992-04-30)	1-9
Y	table 6; compounds 465, 466, 467 Herbicidal use, herbicidal compositionsclaim 11	1-9
	----- -/--	
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents : "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art. "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
11 October 2011		17/10/2011
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Lange, Tim

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2011/066628

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 94/03454 A1 (DU PONT [US]; TAYLOR ERIC DEGUYON [US]) 17 February 1994 (1994-02-17) 12th entry; page 44; table 11 Use as herbicideclaim 10 Compositions:claim 9 -----	1-9
X	WO 90/06748 A2 (FMC CORP [US]) 28 June 1990 (1990-06-28) page 22; compound 6g Herbicidal PPO inhibitor for use in photodynamic therapy; abstract; claims 10-11 -----	1-9
Y	EP 0 170 191 A2 (SUMITOMO CHEMICAL CO [JP]) 5 February 1986 (1986-02-05) page 11; table 1; compound 50 Use as herbicideclaim 19 -----	1-9
Y	JP 2000 247975 A (NISSAN CHEMICAL IND LTD) 12 September 2000 (2000-09-12) page 15, paragraph 0067 page 15, paragraph 0069 & DATABASE WPI [Online] THOMSON SCIENTIFIC, LONDON, GB; Database accession no. 2001-027308 the whole document -----	1-9
Y	CN 100 386 324 C (SHENYANG CHEMICAL INST [CN]) 7 May 2008 (2008-05-07) page 12; compound 14 & DATABASE WPI [Online] THOMSON SCIENTIFIC, LONDON, GB; Database accession no. 2006-165658 the whole document -----	1-9

INTERNATIONAL SEARCH REPORTInternational application No.
PCT/EP2011/066628**Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of Item 2 of first sheet)**

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

2. Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

see additional sheet

1. As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.

2. As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.

3. As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

4. No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, the payment of a protest fee.
- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.
- No protest accompanied the payment of additional search fees.

International Application No. PCT/ EP2011/ 066628

FURTHER INFORMATION CONTINUED FROM PCT/ISA/ 210

This International Searching Authority found multiple (groups of) inventions in this international application, as follows:

1. claims: 1-9(partially)

Compounds of formula (I), wherein the variable "Y" takes the value "5-ring N-heterocycle, being directly connected to the benzoxazinone structure through a C-C bond", compositions with such compounds and their use as herbicide.

2. claims: 1-3, 5-9(all partially)

Compounds of formula (I), wherein the variable "Y" takes the value "5-ring N-heterocycle, being directly connected to the benzoxazinone structure through a N-C bond", compositions with such compounds and their use as herbicide.

3. claims: 1-9(partially)

Compounds of formula (I), wherein the variable "Y" takes the value "6-ring N-heterocycle, being directly connected to the benzoxazinone structure through a C-C bond", compositions with such compounds and their use as herbicide.

4. claims: 1-9(partially)

Compounds of formula (I), wherein the variable "Y" takes the value "6-ring N-heterocycle, being directly connected to the benzoxazinone structure through a N-C bond", compositions with such compounds and their use as herbicide.

5. claims: 1-3, 5-9(all partially)

Compounds of formula (I), wherein the variable "Y" takes the value "5- or 6-ring N-heterocycle, being connected through an imino bridge ("=N-") to the benzoxazinone structure", compositions with such compounds and their use as herbicide.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2011/066628

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9315074	A1	05-08-1993	AU 3425893 A 01-09-1993
			BR 9207078 A 05-12-1995
			CA 2128736 A1 05-08-1993
			DE 69228707 D1 22-04-1999
			DE 69228707 T2 21-10-1999
			EP 0626962 A1 07-12-1994
			ES 2131104 T3 16-07-1999
			JP 3383813 B2 10-03-2003
			JP H07504403 A 18-05-1995
			KR 100263134 B1 01-08-2000
WO 9206962	A1	30-04-1992	AT 174330 T 15-12-1998
			AT 269290 T 15-07-2004
			AU 653758 B2 13-10-1994
			BG 97638 A 31-03-1994
			BR 9107049 A 28-09-1993
			CA 2092083 A1 19-04-1992
			CN 1061777 A 10-06-1992
			CN 1090845 A 17-08-1994
			CZ 9300637 A3 15-12-1993
			DE 69130614 D1 21-01-1999
			DE 69130614 T2 08-07-1999
			DE 69133397 D1 22-07-2004
			DE 69133397 T2 30-06-2005
			DK 0553307 T3 16-08-1999
			EP 0553307 A1 04-08-1993
			EP 0791571 A1 27-08-1997
			ES 2059290 T1 16-11-1994
			ES 2224193 T3 01-03-2005
			FI 931708 A 10-06-1993
			GR 3029621 T3 30-06-1999
			HU 215711 B 01-02-1999
			IE 913642 A1 22-04-1992
			IE 990098 A1 01-11-2000
			JP H06502637 A 24-03-1994
			NZ 240282 A 27-04-1994
			PT 99261 A 31-08-1992
			RU 2137761 C1 20-09-1999
			SK 35993 A3 07-07-1993
			US 5489571 A 06-02-1996
			US 5536700 A 16-07-1996
US 5530126 A 25-06-1996			
US 5281571 A 25-01-1994			
WO 9403454	A1	17-02-1994	AU 4653693 A 03-03-1994
			EP 0652876 A1 17-05-1995
WO 9006748	A2	28-06-1990	AR 243605 A1 31-08-1993
			AT 400520 B 25-01-1996
			AU 633537 B2 04-02-1993
			AU 4822290 A 10-07-1990
			BR 8907817 A 22-10-1991
			CA 2004979 A1 12-06-1990
			CH 681779 A5 28-05-1993
			DE 3991484 C2 23-02-1995
			DE 3991484 T 21-11-1991
			DK 110791 A 12-08-1991
			EG 18822 A 29-09-1994

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2011/066628

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
		EP 0447491 A1	25-09-1991
		ES 2051675 T1	01-07-1994
		GB 2247404 A	04-03-1992
		GR 89100817 A	15-03-1991
		HU T58202 A	28-02-1992
		IE 62621 B1	22-02-1995
		IL 92622 A	14-05-1996
		JP 2545000 B2	16-10-1996
		JP H04501420 A	12-03-1992
		LU 87949 A1	16-12-1991
		LV 10303 A	20-10-1994
		MC 2171 A	22-05-1992
		NZ 231658 A	26-05-1992
		OA 9362 A	15-09-1992
		PT 92546 A	29-06-1990
		SE 505938 C2	27-10-1997
		SE 9101807 A	12-06-1991

EP 0170191	A2	05-02-1986	
		AU 581823 B2	02-03-1989
		AU 1117788 A	28-07-1988
		AU 570812 B2	24-03-1988
		AU 4523085 A	30-01-1986
		BR 8503490 A	15-04-1986
		CA 1253863 A1	09-05-1989
		CS 8505440 A2	16-05-1988
		DE 3574379 D1	28-12-1989
		DK 49095 A	25-04-1995
		DK 333885 A	24-01-1986
		ES 8609313 A1	16-12-1986
		HU 199250 B	28-02-1990
		PL 254653 A1	05-10-1987
		US 4880925 A	14-11-1989
		US 4640707 A	03-02-1987
		US 4792605 A	20-12-1988

JP 2000247975	A	12-09-2000	NONE

CN 100386324	C	07-05-2008	CN 1687061 A 26-10-2005

フロントページの続き

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
C 0 7 D 487/04 (2006.01)	A 0 1 P 13/00	
C 0 7 D 471/04 (2006.01)	C 0 7 D 487/04 1 3 8	
C 0 7 D 513/04 (2006.01)	C 0 7 D 471/04 1 0 1	
	C 0 7 D 513/04 3 5 1	

(81) 指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, T J, TM), EP(AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, R O, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, H U, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI , NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN

(74) 代理人 100111741

弁理士 田中 夏夫

(72) 発明者 ニュートン, トレヴァー ウィリアム

ドイツ連邦共和国 6 7 4 3 5 ノイシュタット, ノイベルクシュトラーク 3 0

(72) 発明者 ザイツ, トーマス

ドイツ連邦共和国 6 8 5 1 9 フィールンハイム, エミル - ノルデ - シュトラーク 1 0

(72) 発明者 ヴィトシエル, マティアス

ドイツ連邦共和国 6 7 0 9 8 パート デュルクハイム, ヘーエンヴェーク 1 2 ペー

(72) 発明者 サイモン, アニャ

ドイツ連邦共和国 6 9 4 6 9 ヴァインハイム, クリンゲンヴェーク 1 0

(72) 発明者 ヴァルター, ヘルムト

ドイツ連邦共和国 6 7 2 8 3 オプリヒハイム, グリュンシュタッター シュトラーク 8 2

(72) 発明者 エバンス, リチャード ロジャー

ドイツ連邦共和国 6 7 1 1 7 リンブルガーホフ, クロップスブルクシュトラーク 2 4

F ターム(参考) 4C050 AA01 BB04 CC04 EE02 FF01 GG03 HH04

4C063 AA01 BB02 CC54 CC58 DD25 DD28 DD31 DD52 DD54 EE03

4C065 AA03 BB03 CC01 DD03 EE02 HH01 JJ01 KK01 LL04 PP16

4C072 AA01 BB02 CC02 CC16 DD10 EE12 FF08 GG07 GG08 HH07

UU02

4H011 AB01 BB09 BB10 BB11 DA15 DA16 DD03 DD04

【要約の続き】

のベンゾオキサジノンを提供する。式 I のベンゾオキサジノンは除草剤として有用である。

【選択図】なし