

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2001年3月8日 (08.03.2001)

PCT

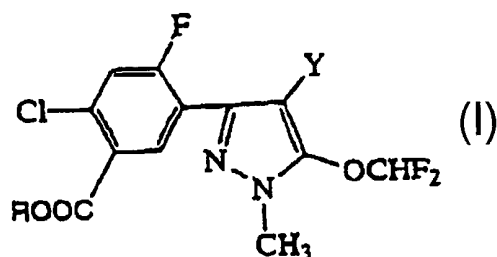
(10) 国際公開番号
WO 01/16112 A1

- (51) 国際特許分類⁷: C07D 231/20, A01N 43/56 (74) 代理人: 浅村 皓, 外(ASAMURA, Kiyoshi et al.); 〒100-0004 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 新大手町ビル331 Tokyo (JP).
- (21) 国際出願番号: PCT/JP00/05720
- (22) 国際出願日: 2000年8月24日 (24.08.2000) (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.
- (25) 国際出願の言語: 日本語 (84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願平11/239909 1999年8月26日 (26.08.1999) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本農薬株式会社 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) [JP/JP]; 〒103-8236 東京都中央区日本橋1丁目2番5号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 三浦友三 (MIURA, Yuzo) [JP/JP]; 〒584-0036 大阪府富田林市甲田2丁目2-5-403 Osaka (JP). 馬淵 勉 (MABUCHI, Tsutomu) [JP/JP]; 〒589-0011 大阪府大阪狭山市半田3丁目361-1-611 Osaka (JP). 大塚 隆 (OHTSUKA, Takashi) [JP/JP]; 〒584-0062 大阪府富田林市大字須賀74-1-602 Osaka (JP).
- 添付公開書類:
— 国際調査報告書
- 2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。



(54) Title: BENZOATE COMPOUNDS, HERBICIDES AND METHOD OF USING THE SAME

(54) 発明の名称: 安息香酸エステル化合物及び除草剤並びにその使用方法



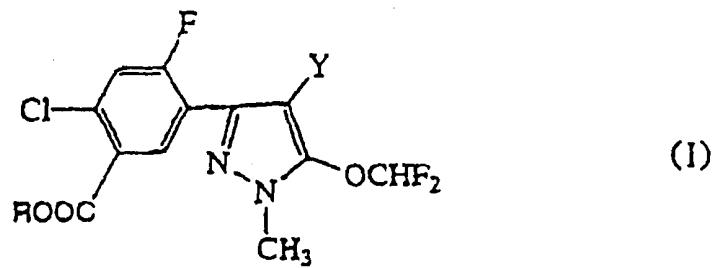
(57) Abstract: Benzoate compounds represented by general formula (I) and herbicides containing these compounds as the active ingredient, wherein R represents isopropyl, -CH₂COOR¹ (wherein R¹ represents C₁₋₃ alkyl) or -CH(CH₃)COOR¹ (wherein R¹ is as defined above) when Y is bromo, or R represents isopropyl when Y is chloro. The herbicides containing the benzoate compounds represented by general formula (I) have an excellent herbicidal activity in a small dose in soil treatment and a high selectivity among crops and weeds, which makes them highly useful in elevating agricultural productivity.

WO 01/16112 A1



(57) 要約:

本発明は、一般式(I) :



(式中、Yが臭素原子の場合、Rはイソプロピル基、 $-\text{CH}_2\text{COOR}^1$ (式中、 R^1 は C_1-C_3 アルキル基を示す。) 又は $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{COOR}^1$ (式中、 R^1 は前記に同じ。) を示し、Yが塩素原子の場合、Rはイソプロピル基を示す。)

で表される安息香酸エステル化合物及び該化合物を有効成分とする除草剤並びにその使用方法に関する。本発明の一般式(I) で表される安息香酸エステル化合物を含有する除草剤は土壌処理において低薬量で優れた除草活性を有し、且つ作物と雑草間の選択性が高く、農業生産性の向上に有用なものである。

明 細 書

安息香酸エステル化合物及び除草剤並びにその使用方法

5 技術分野

本発明は一般式(I) で表される安息香酸エステル化合物及び該化合物を有効成分として含有する除草剤並びにその使用方法に関するものである。

背景技術

特開平3-163063号公報には本発明化合物を一般式中に含む3-置換フェニルピラゾール誘導体が除草剤として有用であることが記載されている。しかし、本願発明の一般式(I) で表される安息香酸エステル化合物について物性、使用方法等の具体的記載は全く記載されていない。

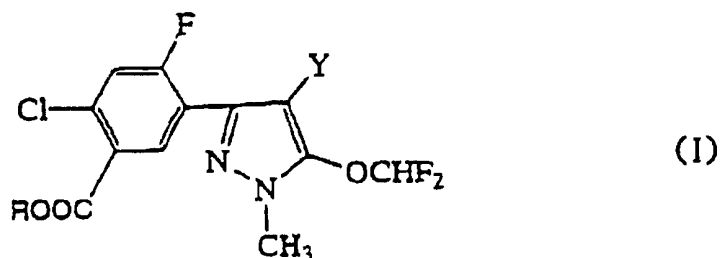
現在、低薬量で活性を示し、作物と雑草との選択が高い除草剤の創出が強く求められており、特に雑草防除を効率良く行うためには、茎葉処理除草剤ばかりでなく、土壌処理除草剤も必要である。農作業には各種の作業が必要であるが、除草作業は中でも重要かつ労力のかかる作業である。除草作業が他の作業と同時に行えるか又は他の作業とぶつからない時期にできれば農業生産の効率化につながる。近年、農業用機械の発展とともに多種の作業を併行して実施できるものが現れてきており、田植えと同時に肥料や農薬を散布できる機械が知られている。耕耘とともに除草剤を散布すればその後の除草作業を省くことができるので効率的である。

本発明者等は低薬量で活性が高く、土壌処理における選択性が高い除草剤を開発すべく鋭意研究を重ねた結果、本願発明の一般式(I) で表される安息香酸エステル化合物が文献未記載の新規化合物であり、特開平3-163063号公報に開示の化合物に比して優れた除草活性を示し、土壌処理において高い選択性を有

発明の開示

本発明は一般式(I) :

5



(式中、Yが臭素原子の場合、Rはイソプロピル基、 $-\text{CH}_2\text{COOR}^1$ (式中、 R^1 は C_1-C_3 アルキル基を示す。) 又は $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{COOR}^1$ (式中、 R^1 は前記に同じ。) を示し、Yが塩素原子の場合、Rはイソプロピル基を示す。)

10

で表される安息香酸エステル化合物及び該化合物を有効成分とする除草剤並びにその使用方法に関するものである。

15

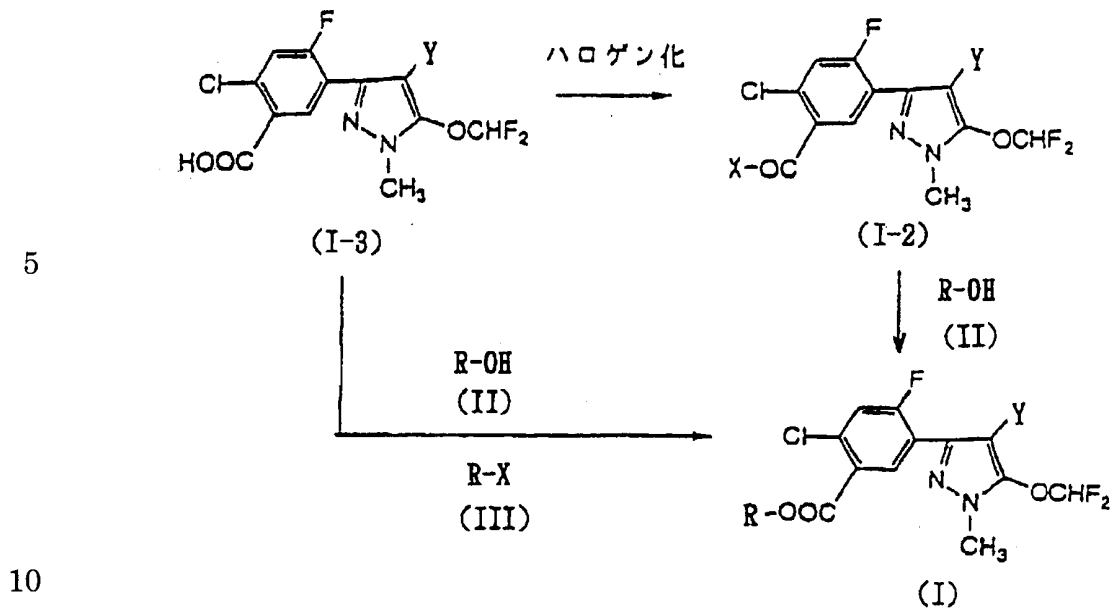
本発明の一般式(I)の定義中、「 C_1-C_3 アルキル基」とは、炭素原子数1~3の直鎖状又は分枝状のアルキル基を示し、例えばメチル基、エチル基、ノルマルプロピル基、イソプロピル基を示す。

20

本発明の好ましい化合物としては、例えば2-クロロ-5-(4-クロロ-5-ジフルオロメトキシ-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-4-フルオロ安息香酸 イソプロピル、2-クロロ-5-(4-ブロモ-5-ジフルオロメトキシ-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-4-フルオロ安息香酸 イソプロピルを例示することができる。

発明を実施するための形態

本発明化合物は特開平3-163063号公報記載の方法に従って製造することができるが、例えば以下に図示する製造方法により製造することもできる。



(式中、R及びYは前記に同じくし、Zはハロゲン原子を示す。)

- 一般式(I-3)で表される化合物を不活性溶媒の存在下又は不存在下のハロゲン化剤によりハロゲン化反応を行い、一般式(I-2)で表される酸ハライド類とし、
- 15 該酸ハライド類を単離し又は単離せずして一般式(II)で表されるアルコール類と反応させるか、一般式(I-3)で表される化合物を不活性溶媒の存在下又は不存在下、鉍酸類の存在下に一般式(II)で表されるアルコール類と反応させるか、又は一般式(I-3)で表される化合物を不活性溶媒の存在下又は不存在下、脱ハロゲン化剤の存在下の一般式(III)で表されるハライド類と反応させることにより、目的とする一般式(I)で表される安息香酸エステル化合物を製造することができる。
- 20

(1) . 一般式(I-3) → 一般式(I-2).

- 本反応は酸ハライド化の反応であり、本反応で使用できる不活性溶媒としては、例えば塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メチルセロソルブ、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類等を使用することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は混合して使用することもできる。
- 25

ハロゲン化剤としては、例えば塩化チオニル、五塩化リン、三塩化リン等を使用することができ、ハロゲン化剤の使用量は一般式(I-3)で表される化合物に対

して等モル乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良く、好ましくは過剰量使用するのが良い。又、本反応を促進させる目的で触媒量のトリエチルアミン、ピリジン、ジメチルホルムアミド、テトラメチルチオ尿素等を添加しても反応することができる。

- 5 反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の沸点域から選択すれば良く、反応時間は反応量、反応温度によって一定しないが、数分乃至48時間の範囲から適宜選択すれば良い。

反応終了後、目的物を含む反応液から過剰のハロゲン化剤及び溶媒を留去等して除き、目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶法、蒸留法等の方法により精製を行い、次の反応に供することもでき、単離精製せずして次の反応に供することもできる。

(2) . 一般式(I-2) 又は一般式(I-3) →一般式(I)

本反応は、エステル化反応では、一般式(II)で表されるアルコール類を鉱酸類、例えば濃硫酸等の存在下に過剰に使用し、反応剤及び溶剤として使用することができる。又、一般式(I-3)化合物はアルカリ金属原子等の塩の形で使用することもできる。更に、不活性溶媒及び脱ハロゲン化剤の存在下にエステル化反応を行うことができ、この場合使用できる不活性溶媒としては、例えば酸ハライド化反応で使用する不活性溶媒の他に、アセトン等のケトン類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ジメチルイミダゾール、ジメチルアセトアミド等の非プロトン性溶媒を使用することができる。

一般式(II)で表されるアルコール類又は一般式(III)で表されるハライド類の使用量は等モル乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良く、好ましくは過剰モル使用するのが良い。

本反応で使用できる脱ハロゲン化剤としては、無機塩基又は有機塩基を使用することができる。例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属原子の水酸化物、有機塩基としては、例えばトリエチルアミン等の三級アミン類、4-ジメチルアミノピリジン、1,8-ジアザビスクロ[5,4,0]-7-ウンデセン等の有機塩基等を使用することができる。その使用量は一般式(I-2)で表される酸ハライド類に対して等モル乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用

すれば良い。

反応温度は0℃乃至使用する溶媒の沸点域から選択すれば良く、好ましくは0℃乃至150℃の範囲から選択すれば良い。

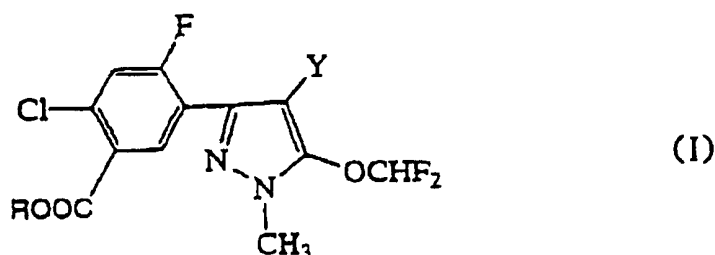
反応時間は、反応量、反応温度等によって一定しないが、数分乃至48時間の範囲から選択すれば良い。

反応終了後は、反応液から常法により、例えば溶媒抽出等の操作を行い、必要に応じて再結晶法、蒸留法、カラムクロマトグラフィー法等の方法により精製することにより、一般式(I)で表される安息香酸エステル化合物を製造することができる。

10 第1表に一般式(I)で表される安息香酸エステル化合物の代表的な化合物を例示する。

一般式(I) :

15



第1表

20

No	Y	R	物性 (屈折率)
1	Cl	-i-C ₃ H ₇	nD 1.5273 (24.3 °C)
2	Br	-i-C ₃ H ₇	nD 1.5403 (28.7 °C)
3	Br	-CH ₂ COOCH ₃	nD 1.5465 (26.2 °C)
4	Br	-CH ₂ COOC ₂ H ₅	nD 1.5420 (26.3 °C)
5	Br	-CH(CH ₃)COOCH ₃	nD 1.5398 (26.9 °C)
6	Br	-CH(CH ₃)COOC ₂ H ₅	nD 1.5343 (28.7 °C)

本発明の一般式(I) で表される安息香酸エステル化合物を有効成分とする除草剤は、例えばイヌビエ（イネ科1年生、水田の害草）、タマガヤツリ（カヤツリグサ科1年生草、水田の害草）、マツバイ（カヤツリグサ科多年生草、湿地、水路、水田に発生、水田の多年生害草）、ウリカワ（オモダカ科、水田、湿地、溝に発生する多年生害草）、ホタルイ（カヤツリグサ科多年生草、水田、湿地、溝に発生）、スズメノテッポウ（イネ科雑草、水田、低湿地に発生）、エンバク（イネ科越年草、平地、荒地、畑地に発生）、ヨモギ（キク科多年生草、山野、畑地に発生）、メヒシバ（イネ科1年生草、畑、樹園地の強害草）、ギシギシ（タデ科多年生草、畑地、道端に発生）、コゴメガヤツリ（カヤツリグサ科1年生草、アオビユ（ヒユ科1年生草、空き地、道端、畑地に発生）、オナモミ（キク科1年生草、畑地の害草）、イチビ（アオイ科1年生草、畑地の害草）、ヨウシュチョウセンアサガオ（ヒルガオ科1年生草、畑地の害草）、オオイヌノフグリ（ゴマノハグサ科1～2年生草、畑地の害草）、ヤエムグラ（アカネ科1年生草、畑地、樹園地の害草）等の水田、畑、樹園地、湿地等に発生する1年生及び多年生雑草等を除草するのに有用である。

本発明の一般式(I) で表される安息香酸エステル化合物を有効成分とする除草剤は出芽前及び出芽後にある雑草に対して優れた除草効果、特に出芽前の処理により優れた除草効果を示す。その態様は有用植物の植え付け予定地に予め処理するとか、有用植物の播種、植え付け等の後（有用植物が樹園のごとく既に定植されている場合を含む）雑草の発生前から発生始期に処理することにより本発明除草剤の有する特徴ある生理活性を効果的に発現させることができる。

しかし、本発明の除草剤はこのような態様においてのみ使用されねばならないというものではなく、例えば本発明除草剤は水田用除草剤として使用することができ、一般雑草の除草剤としても使用することができ、例えば刈り取り跡、休耕田畑、畦畔、農道、水路、牧草造成地、墓地、公園、道路、運動場、建物の周辺の空き地、開墾地、線路端、森林等の一般雑草の防除するために使用することもできる。この場合、雑草の発生始期までに処理するのが経済的にも最も効果的であるが、必ずしもこれに限定されず、生育期にある雑草をも防除することが可能である。好ましくは雑草発生前に使用すると良い。

本発明の一般式(I) で表される安息香酸エステル化合物を有効成分を除草剤として使用する場合、農薬製剤上の常法に従い、使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。

即ち、一般式(I) で表される安息香酸エステル化合物は、これらを適当な不活性担体に又は必要に応じて補助剤と一緒に、適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させ、適宜の剤形、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、粒剤、粉剤、錠剤等に製剤して使用すれば良い。

本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、固体の担体になりうる材料としては、例えばダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、繊維素粉末、植物エキス抽出後の残渣、粉砕合成樹脂等の合成重合体、粘土類（例えばカオリン、ベントナイト、酸性白土等）、タルク類（例えばタルク、ピロフィライド等）、シリカ類（例えば珪藻土、珪砂、雲母、ホワイトカーボン〔含水微粉珪素、含水珪酸ともいわれる合成高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。〕）、活性炭、イオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、レンガ粉砕物、フライアッシュ、砂、炭酸カルシウム、磷酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、硫安、磷安、硝安、尿素、塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で又は二種以上の混合物として使用することができる。

液体の担体になりうる材料としては、それ自体溶媒能を有するものの他、溶媒能を有さずとも補助剤の助けにより本発明化合物を分散させうるものであれば良く、例えば水、アルコール類（例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール等）、ケトン類（例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等）、エーテル類（例えばエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等）、脂肪族炭化水素類（例えばケロシン、鉱油等）、芳香族炭化水素類（例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等）、ハロゲン化炭化水素類（例えばジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等）、エステル類（例えば酢酸エチル、ジイソプロピルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート等）、

アミド類（例えばジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等）、ニトリル類（例えばアセトニトリル等）、ジメチルスルホキシド類等を挙げることができ、これらは単独で又は二種以上の混合物として使用することができる。

- 5 他の補助剤としては、次に例示する代表的な補助剤をあげることができ、これらの補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用し、又ある場合には全く補助剤を使用しないことも可能である。

本発明化合物の乳化、分散、可溶化及び／又は湿潤の目的のために界面活性剤が使用され、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリールスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸縮合物、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸エステル等の界面活性剤を例示することができる。

- 15 又、本発明化合物の分散安定化、粘着及び／又は結合の目的のために、例えばカゼイン、ゼラチン、澱粉、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、松根油、糠油、ベントナイト、リグニンスルホン酸塩等の補助剤を使用することもできる。

固体製品の流動性改良のために、例えばワックス、ステアリン酸塩、磷酸アルキルエステル等の補助剤を使用でき、懸濁性製品の解こう剤として、例えばナフタレンスルホン酸縮合物、縮合磷酸塩等の補助剤を使用することもできる。

消泡剤としては、例えばシリコン油等の補助剤を使用することもできる。

- 本発明化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、例えば粉剤或いは粒剤とする場合は0.01～50重量%、又乳剤或いは水和剤とする場合も同様0.01～50重量%が適当である。

本発明化合物を有効成分とする除草剤は各種雑草を枯殺し若しくは生育を抑制するために、そのまま又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で殺草若しくは生育抑制に有効な量を当該雑草に、又は当該雑草の発生若しくは生育が好ましくない場所において茎葉又は土壤に適用して使用すればよい。

本発明化合物を含有する除草剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象雑草、作物の生育状況、雑草の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として1ヘクタール当たり0.1g～10kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

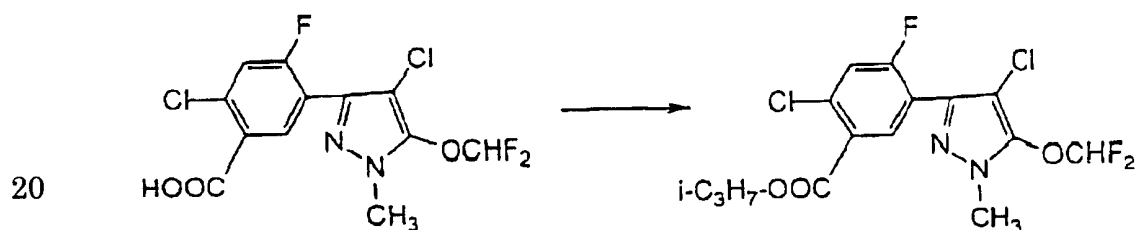
- 5 本発明化合物を含有する除草剤を更に防除対象雑草、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の除草剤と混合して使用することも可能である。

本発明の一般式(I)で表される安息香酸エステル化合物を含有する除草剤は土壌処理において低薬量で優れた除草活性を有し、且つ作物と雑草間の選択性が高く、農業生産性の向上に有用なものである。

実施例

以下に本発明の代表的な実施例、製剤例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。尚、製剤例中、部とあるのは重量部を示す。

- 15 実施例1. 2-クロロ-5-(4-クロロ-5-ジフルオロメトキシ-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-4-フルオロ安息香酸 イソプロピル (化合物No. 1) の製造



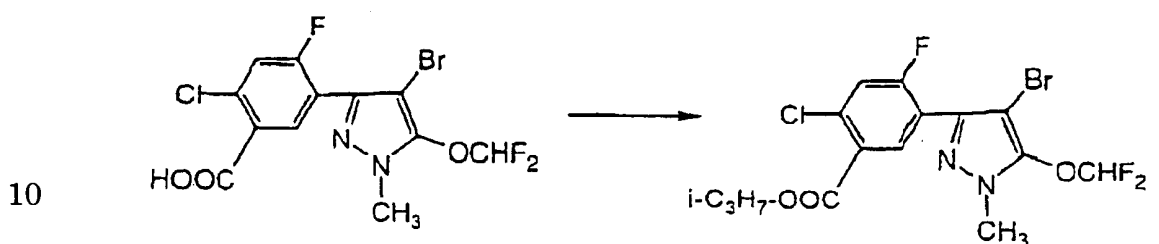
- 25 2-クロロ-5-(4-クロロ-5-ジフルオロメトキシ-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-4-フルオロ安息香酸1.705g(0.00477モル)、ジメチルスルホキシド40ml、無水炭酸カリウム0.989g(0.00716モル)及び沃化イソプロピル1.218g(0.00716モル)の混合液を室温下に4時間反応させた。反応終了後、反応混合液を氷水200ml中へ注ぎ、目的物を酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗後、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた後、溶媒を減圧下に留去し、得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーにて精製することにより目的物を油状物として1.

858 g 得た。

物性：nD 1.5273 (24.3°C)

収率：97.8%

実施例 2. 2-クロロ-5-(4-ブロモ-5-ジフルオロメトキシ-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-4-フルオロ安息香酸 イソプロピル (化合物No. 2) の製造



2-クロロ-5-(4-ブロモ-5-ジフルオロメトキシ-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-4-フルオロ安息香酸 0.15 g (0.00037 モル)、ジメチルスルホキシド 20 ml、無水炭酸カリウム 0.077 g (0.00056 モル) 及び沃化イソプロピル 0.095 g (0.00056 モル) の混合液を室温下に 4 時間反応させた。反応終了後、反応混合液を氷水 80 ml 中へ注ぎ、目的物を酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗後、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥させた後、溶媒を減圧下に留去し、得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーにて精製することにより目的物を油状物として 0.12 g 得た。

20

物性：nD 1.5403 (28.7°C)

収率：72.4%

製剤例 1.

第 1 表記載の化合物	50 部
25 キシレン	40 部
ポリオキシエチレンニルフェニルエーテルと	
アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	10 部

以上を均一に混合溶解して乳剤とする。

製剤例 2.

第1表記載の化合物	3部
クレー粉末	82部
珪藻土粉末	15部

以上を均一に混合粉砕して粉剤とする。

5 製剤例3.

第1表記載の化合物	5部
ベントナイトとクレーの混合粉末	90部
リグニンスルホン酸カルシウム	5部

以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。

10 製剤例4.

第1表記載の化合物	20部
カオリンと合成高分散珪酸	75部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルとアル キルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	5部

15 以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

試験例1. 出芽前の畑地雑草に対する除草効果

縦10cm×横20cm×高さ5cmのプラスチック製バットに土壌を詰め、これにイヌカミツレ、ハコベ、スマレ及びコムギ（品種：アンザ、Anza）の種子を播種覆土した。これに第1表記載の化合物又は比較化合物を有効成分とする薬剤を所定濃度の散布液として処理した。処理後28日後に除草効果を調査した。肉眼判定による判定値〔0（活性なし又は薬害なし）～100（完全枯死）〕を記した。コムギに対する薬害を処理後7日後と処理後28日後に調査し、肉眼判定値による判定値を記した。

尚、肉眼判定20以上の薬害の場合、収量に影響があり、農業生産上許容できないものである。結果を第1表に示す。

25

第2表

供試化合物 No	供試薬量 (gAI/ha)	薬害(コメ)		除草効果(28日後)		
		7日後	28日後	イカミツ	ハコベ	スミレ
1	30	0	0	100	90	100
	100	5	0	100	100	100
2	30	0	0	100	90	95
	100	3	0	100	100	100
比較化合物	30	30	10	100	100	60
	100	50	20	100	100	80

比較化合物：特開平3-163063号公報記載の化合物No. 498を使用した。

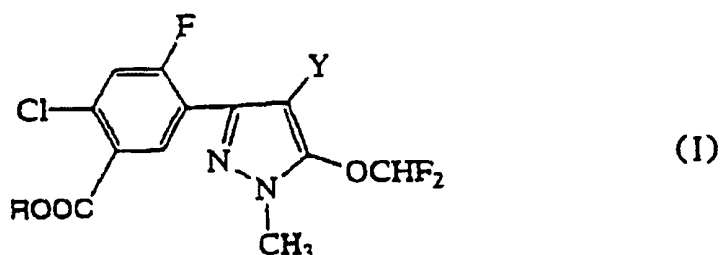
5

[2-クロロ-5-(4-クロロ-5-ジフルオロメトキシ-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-4-フルオロ安息香酸メチル]

請求の範囲

1. 一般式(I) :

5



- 10 (式中、Yが臭素原子の場合、Rはイソプロピル基、 $-\text{CH}_2\text{COOR}^1$ (式中、 R^1 は C_1-C_3 アルキル基を示す。) 又は $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{COOR}^1$ (式中、 R^1 は前記に同じ。) を示し、Yが塩素原子の場合、Rはイソプロピル基を示す。)

で表される安息香酸エステル化合物。

- 15 2. 安息香酸エステル化合物が2-クロロ-5-(4-クロロ-5-ジフルオロメトキシ-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-4-フルオロ安息香酸 イソプロピル、2-クロロ-5-(4-ブロモ-5-ジフルオロメトキシ-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-4-フルオロ安息香酸 イソプロピル、2-クロロ-5-(4-ブロモ-5-ジフルオロメトキシ-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-4-フルオロ安息香酸 メトキシカルボニルメチル、2-クロロ-5-(4-ブロモ-5-ジフルオロメトキシ-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-4-フルオロ安息香酸 エトキシカルボニルメチル、2-クロロ-5-(4-ブロモ-5-ジフルオロメトキシ-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-4-フルオロ安息香酸 1-(メトキシカルボニル)エチル又は2-クロロ-5-(4-ブロモ-5-ジフルオロメトキシ-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-4-フルオロ安息香酸

20

1-(エトキシカルボニル)エチルである請求項1記載の安息香酸エステル化合物。

3. 請求項1又は2記載の安息香酸エステル化合物を有効成分として含有する

ことを特徴とする除草剤。

4. 除草剤が土壌処理用除草剤である請求項 3 記載の除草剤。
 5. 処理対象が麦である請求項 3 又は 4 記載の土壌処理用除草剤。
 6. 請求項 3 乃至 5 いずれか 1 項記載の除草剤の有効量を対象植物又は土壌に
- 5 処理することを特徴とする除草剤の使用方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/05720

<p>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER Int.Cl⁷ C07D231/20, A01N43/56</p> <p>According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC</p>											
<p>B. FIELDS SEARCHED</p> <p>Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) Int.Cl⁷ C07D231/20, A01N43/56</p> <p>Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched</p> <p>Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) CAPLUS (STN) , REGISTRY (STN)</p>											
<p>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</p> <table border="1"> <thead> <tr> <th>Category*</th> <th>Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages</th> <th>Relevant to claim No.</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>X Y</td> <td>EP, 361114, A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 04 April, 1990 (04.04.90), especially, Claim 4, Compound Nos. 498,500,507,508 & JP, 3-163063, A & AU, 8940865, A & CA, 1316175, A & US, 5032165, A & ZA, 9001486, A & HU, 56349, A & CN, 1054421, A</td> <td>1-6</td> </tr> <tr> <td>Y</td> <td>WO, 92/06962, A1 (MONSANTO COMPANY), 30 April, 1992 (30.04.92), especially, Compound Nos. 135,143,150,151 & JP, 6-502637, A & US, 5281571, A & AU, 9189275, A & EP, 553307, A1</td> <td>1-6</td> </tr> </tbody> </table>			Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.	X Y	EP, 361114, A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 04 April, 1990 (04.04.90), especially, Claim 4, Compound Nos. 498,500,507,508 & JP, 3-163063, A & AU, 8940865, A & CA, 1316175, A & US, 5032165, A & ZA, 9001486, A & HU, 56349, A & CN, 1054421, A	1-6	Y	WO, 92/06962, A1 (MONSANTO COMPANY), 30 April, 1992 (30.04.92), especially, Compound Nos. 135,143,150,151 & JP, 6-502637, A & US, 5281571, A & AU, 9189275, A & EP, 553307, A1	1-6
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.									
X Y	EP, 361114, A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 04 April, 1990 (04.04.90), especially, Claim 4, Compound Nos. 498,500,507,508 & JP, 3-163063, A & AU, 8940865, A & CA, 1316175, A & US, 5032165, A & ZA, 9001486, A & HU, 56349, A & CN, 1054421, A	1-6									
Y	WO, 92/06962, A1 (MONSANTO COMPANY), 30 April, 1992 (30.04.92), especially, Compound Nos. 135,143,150,151 & JP, 6-502637, A & US, 5281571, A & AU, 9189275, A & EP, 553307, A1	1-6									
<p><input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input type="checkbox"/> See patent family annex.</p>											
<p>* 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</p>		<p>"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</p>									
<p>Date of the actual completion of the international search 16 November, 2000 (16.11.00)</p>		<p>Date of mailing of the international search report 28 November, 2000 (28.11.00)</p>									
<p>Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office</p>		<p>Authorized officer</p>									
<p>Facsimile No.</p>		<p>Telephone No.</p>									

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC)) Int.Cl ¹ C07D231/20, A01N43/56		
B. 調査を行った分野 調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC)) Int.Cl ¹ C07D231/20, A01N43/56		
最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの		
国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語) CAPLUS (STN), REGISTRY (STN)		
C. 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X Y	EP, 361114, A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.) 4. April 1990 (04. 04. 90) 特に、クレーム4, No. 498, 500, 507, 508の化合物 & JP, 3-163063, A & AU, 8940865, A & CA, 1316175, A & US, 5032165, A & ZA, 9001486, A & HU, 56349, A & CN, 1054421, A	1-6
Y	WO, 92/06962, A1 (MONSANTO COMPANY) 30. April 1992 (30. 04. 92) 特に、No. 135, 143, 150, 151の化合物 & JP, 6-502637, A & US, 5281571, A & AU, 9189275, A&EP, 553307, A1	1-6
<input type="checkbox"/> C欄の続きにも文献が列挙されている。 <input type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。		
* 引用文献のカテゴリー 「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの 「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す) 「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願日の後に公表された文献 「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの 「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの 「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの 「&」 同一パテントファミリー文献		
国際調査を完了した日 16. 11. 00	国際調査報告の発送日 28.11.00	
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 内田 淳子 印	4C 8115
電話番号 03-3581-1101 内線 3452		