(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2006 年1 月19 日 (19.01.2006)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2006/006569 A1

(51) 国際特許分類[7]: C07D 213/81, A01N 43/40, C07D 213/89, 405/04, 405/12, 417/06

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/012781

(22) 国際出願日: 2005 年7 月11 日 (11.07.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2004-204466 2004 年7 月12 日 (12.07.2004) 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]; 〒1038236 東京都中央区日本橋一丁目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): 滝澤 英二 (TAKIZAWA, Eiji). 熊田 秀治 (KUMATA, Shuji). 清川 貴弘 (KIYOKAWA, Takahiro).

(74) 代理人: 小栗 昌平, 外 (OGURI, Shohei et al.); 〒1076013 東京都港区赤坂一丁目１２番３２号アーク森ビル１３階 栄光特許事務所 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

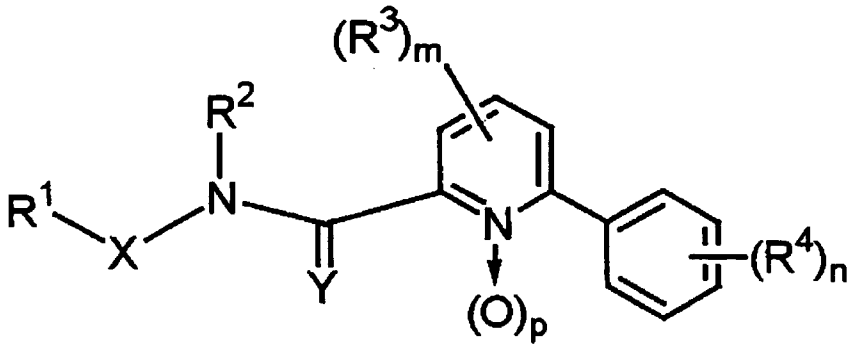
(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

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:** PHENYLPYRIDINE DERIVATIVE OR SALT THEREOF, HERBICIDE CONTAINING THE SAME AS ACTIVE INGREDIENT, AND METHOD OF USE THEREOF

(54) 発明の名称: フェニルピリジン類又はその塩類、これらを有効成分とする除草剤及びその使用方法



(I)

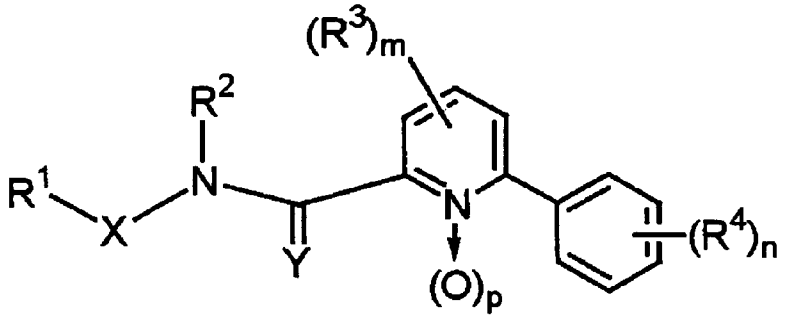
(57) **Abstract:** A phenylpyridine derivative represented by the general formula (I) wherein R^1 represents C_{1-8} alkyl, etc. and R^2 represents hydrogen, etc., provided that R^1 and R^2 in combination may form a 3- to 8-membered ring containing at least one heteroatom selected among oxygen, sulfur, and nitrogen; R^3 represents halogeno, etc.; R^4 represents halo(C_{1-8} alkyl), etc., provided that two adjacent R^4's may be bonded to each other to represent C_{1-4} alkylenedioxy or halo(C_{1-4} alkylenedioxy); X represents oxygen, sulfur, -NH-, or a single bond; Y represents oxygen or sulfur; m is an integer of 0-3; n is an integer of 1-5; and p is 0 or 1.

/続葉有/

WO 2006/006569 A1

(57) 要約:

本発明は、一般式（Ｉ）



（Ｉ）

（式中、Ｒ^{1}はＣ$_{1}$－Ｃ$_{8}$アルキル基等、Ｒ^{2}は水素原子等を示す。又、Ｒ^{1}とＲ^{2}は一緒になって酸素原子、硫黄原子、窒素原子から選択される少なくとも１つのヘテロ原子を含む３―８員環を形成することができる。Ｒ^{3}はハロゲン原子等、Ｒ^{4}はハロＣ$_{1}$－Ｃ$_{8}$アルキル基等を示す。又、２つの隣接するＲ^{4}は互いに一緒になってＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$アルキレンジオキシ基又はハロＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$アルキレンジオキシ基を示すことができる。Ｘは酸素原子、硫黄原子、－ＮＨ－で表される基又は単結合を示し、Ｙは酸素原子又は硫黄原子を示し、ｍは０―３の整数を示し、ｎは１―５の整数を示し、ｐは０又は１を示す。）で表されるフェニルピリジン類又はその塩類、これらを有効成分として含有する除草剤及びその使用方法に関する。

明 細 書

フェニルピリジン類又はその塩類、これらを有効成分とする除草剤及びその使用方法

技術分野

[0001] 本発明は、新規なフェニルピリジン類又はその塩類、これらを有効成分として含有する除草剤及びその使用方法に関する。

背景技術

[0002] 従来、ピリジン誘導体が除草活性及び植物成長調節作用を有することは知られている(例えば、特許文献1乃至6参照。)。又、本発明と類似の構造を有するフェニルピリジンカルボン酸アミド類が医薬活性を有することが知られている(例えば、特許文献7乃至9参照。)。しかしながら、本発明による、特定の位置でベンゼン環とピリジン環とが直結したフェニルピリジンカルボン酸アミド類及びその除草活性については、これまで知られていない。

[0003] 特許文献1:欧州特許出願公開第0955300号明細書

特許文献2:国際公開第98/04550号パンフレット

特許文献3:欧州特許出願公開第0955292号明細書

特許文献4:国際公開第00/75112号パンフレット

[0004] 特許文献5:国際公開第01/00580号パンフレット

特許文献6:国際公開第99/28301号パンフレット

特許文献7:国際公開第04/14844号パンフレット

特許文献8:国際公開第04/02948号パンフレット

特許文献9:米国特許出願公開第2004/0077853号明細書

発明の開示

発明が解決しようとする課題

[0005] 近い将来予想される世界人口増加に伴う食糧危機の解消には、食糧の安定供給が必要不可欠である。安定した食糧の供給には、作物栽培及び収穫時に障害となる雑草の経済的かつ効率の良い枯殺あるいは防除が必要であり、その解決策となる新

しい除草剤や植物成長調節剤の開発がますます重要となっている。

本発明は、このような社会の要請に答えるべく、作物に対する高い安全性と雑草に対する優れた殺草活性を併せ持つ新規な除草剤を提供することを課題とするものである。

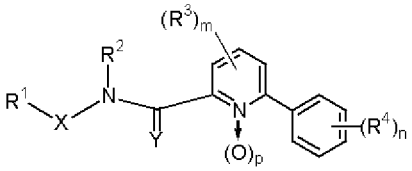
課題を解決するための手段

[0006] 本発明者等は上記の課題を解決すべく鋭意検討した結果一般式(I)で表されるフェニルピリジン骨格を有する化合物群又はその塩類が上記の課題を解決し得る、優れた除草活性を有することを見出し、本発明を完成するに至った。

即ち、本発明は、下記一般式(I):

一般式(I)

[化1]



(I)

(式中、R^1はC_1-C_8アルキル基、ハロC_1-C_8アルキル基、C_2-C_8アルケニル基、ハロC_2-C_8アルケニル基、C_2-C_8アルキニル基、ハロC_2-C_8アルキニル基、C_1-C_6アルコキシC_1-C_6アルキル基、C_1-C_6アルキルチオC_1-C_6アルキル基、C_1-C_6アルキルスルフィニルC_1-C_6アルキル基、C_1-C_6アルキルスルホニルC_1-C_6アルキル基、モノC_1-C_6アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC_1-C_6アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、アミノ基、SH基、C_1-C_6アルキル基、ハロC_1-C_6アルキル基、C_2-C_6アルケニル基、ハロC_2-C_6アルケニル基、C_2-C_6アルキニル基、ハロC_2-C_6アルキニル基、C_1-C_6アルコキシ基、ハロC_1-C_6アルコキシ基、C_1-C_6アルキルチオ基、ハロC_1-C_6アルキルチオ基、C_2-C_6アルケニルチオ基、ハロC_2-C_6アルケニルチオ基、C_1-C_6アルキルスルフィニル基、ハロC_1-C_6アルキルスルフィニル基、C_1-C_6アルキルスルホニル基、ハロC_1-C_6アルキルスルホニル基、C_1-C_6アルキルカルボニル基、ハロC_1-C_6アルキルカルボニル基、フェニルカルボニル基、C_1-C_6アルコキシカルボニル基、モノC_1-C_6アルキルアミノ基又は同一若しくは異なって良いジC_1-C_6アルキルアミノ基から選択される1～5個の置換基を有する置換フ

ェニル基、

[0007] フェニルC_1-C_8アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、アミノ基、SH基、C_1-C_6アルキル基、ハロC_1-C_6アルキル基、C_2-C_6アルケニル基、ハロC_2-C_6アルケニル基、C_2-C_6アルキニル基、ハロC_2-C_6アルキニル基、C_1-C_6アルコキシ基、ハロC_1-C_6アルコキシ基、C_1-C_6アルキルチオ基、ハロC_1-C_6アルキルチオ基、C_2-C_6アルケニルチオ基、ハロC_2-C_6アルケニルチオ基、C_1-C_6アルキルスルフィニル基、ハロC_1-C_6アルキルスルフィニル基、C_1-C_6アルキルスルホニル基、ハロC_1-C_6アルキルスルホニル基、C_1-C_6アルキルカルボニル基、ハロC_1-C_6アルキルカルボニル基、フェニルカルボニル基、C_1-C_6アルコキシカルボニル基、モノC_1-C_6アルキルアミノ基又は同一若しくは異なって良いジC_1-C_6アルキルアミノ基から選択される1～5個の置換基を環上に有する置換フェニルC_1-C_8アルキル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、アミノ基、SH基、C_1-C_6アルキル基、ハロC_1-C_6アルキル基、C_2-C_6アルケニル基、ハロC_2-C_6アルケニル基、C_2-C_6アルキニル基、ハロC_2-C_6アルキニル基、C_1-C_6アルコキシ基、ハロC_1-C_6アルコキシ基、C_1-C_6アルキルチオ基、ハロC_1-C_6アルキルチオ基、C_2-C_6アルケニルチオ基、ハロC_2-C_6アルケニルチオ基、C_1-C_6アルキルスルフィニル基、ハロC_1-C_6アルキルスルフィニル基、C_1-C_6アルキルスルホニル基、ハロC_1-C_6アルキルスルホニル基、C_1-C_6アルキルカルボニル基、ハロC_1-C_6アルキルカルボニル基、フェニルカルボニル基、C_1-C_6アルコキシカルボニル基、モノC_1-C_6アルキルアミノ基又は同一若しくは異なって良いジC_1-C_6アルキルアミノ基から選択される1～5個の置換基を有する置換複素環基、

[0008] 複素環C_1-C_8アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、アミノ基、SH基、C_1-C_6アルキル基、ハロC_1-C_6アルキル基、C_2-C_6アルケニル基、ハロC_2-C_6アルケニル基、C_2-C_6アルキニル基、ハロC_2-C_6アルキニル基、C_1-C_6アルコキシ基、ハロC_1-C_6アルコキシ基、C_1-C_6アルキルチオ基、ハロC_1-C_6アルキルチオ基、C_2-C_6アルケニルチオ基、ハロC_2-C_6アルケニルチオ基、C_1-C_6アルキルスルフィニル基、ハロC_1-C_6アルキルスルフィニル基、C_1-C_6アルキルスルホニル基、ハロC_1-C_6アルキルスルホニル基、C_1-C_6アルキルカルボニル基、ハロC_1-C_6アル

キルカルボニル基、フェニルカルボニル基、C_1-C_6アルコキシカルボニル基、モノC_1-C_6アルキルアミノ基又は同一若しくは異なって良いジC_1-C_6アルキルアミノ基から選択される1～5個の置換基を環上に有する置換複素環C_1-C_8アルキル基を示す。

[0009] R^2は水素原子、C_1-C_8アルキル基、C_2-C_8アルケニル基、C_2-C_8アルキニル基、C_1-C_8アルコキシC_1-C_8アルキル基、シアノC_1-C_8アルキル基、C_1-C_8アルキルカルボニル基、ハロC_1-C_8アルキルカルボニル基、C_2-C_8アルケニルカルボニル基又はC_1-C_8アルコキシカルボニル基を示す。又、R^1とR^2は一緒になって酸素原子、硫黄原子、窒素原子から選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含む3～8員環を形成することができる。

R^3はハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、ペンタフルオロサルファニル基(－SF_5)、C_1-C_8アルキル基、ハロC_1-C_8アルキル基、C_2-C_8アルケニル基、ハロC_2-C_8アルケニル基、C_2-C_8アルキニル基、ハロC_2-C_8アルキニル基、C_1-C_8アルコキシ基、ハロC_1-C_8アルコキシ基、C_1-C_8アルコキシカルボニル基、C_1-C_8アルキルチオ基、C_1-C_8アルキルスルフィニル基、C_1-C_8アルキルスルホニル基、C_1-C_8アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジC_1-C_8アルキルアミノ基を示す。ただし、R^3は、複数の場合には、同一又は異なっても良い。

[0010] R^4はハロゲン原子、C_1-C_8アルキル基、ハロC_1-C_8アルキル基、C_2-C_8アルケニル基、ハロC_2-C_8アルケニル基、C_2-C_8アルキニル基、ハロC_2-C_8アルキニル基、C_1-C_8アルコキシ基、ハロC_1-C_8アルコキシ基、C_1-C_8アルコキシC_1-C_8アルキル基、ハロC_1-C_8アルコキシC_1-C_8アルキル基、C_1-C_8アルコキシC_1-C_8アルコキシ基、ハロC_1-C_8アルコキシC_1-C_8アルコキシ基、C_1-C_8アルキルスルホニルアミノ基、ハロC_1-C_8アルキルスルホニルアミノ基、C_1-C_8アルキルチオ基、ハロC_1-C_8アルキルチオ基、C_1-C_8アルキルスルフィニル基、ハロC_1-C_8アルキルスルフィニル基、C_1-C_8アルキルスルホニル基、ハロC_1-C_8アルキルスルホニル基、C_1-C_8アルキルカルボニル基、C_1-C_8アルコキシカルボニル基、C_1-C_8アルキルカルボニルオキシ基、ハロC_1-C_8アルキルカルボニルオキシ基、水酸基、ホルミル基、シアノ基、ニトロ基、同一又は異なっても良いトリC_1-C_8アルキルシリル基、ペンタフルオロサルファニル基(－SF_5)又は－C(R^5)＝NOR^6(式中、R^5及びR^6は同一又は異なっても良く、水素原子、C_1-C_5アルキル基又はハロC_1-

C_5アルキル基を示す。)で表される基を示す。ただし、R^4は、複数の場合には、同一又は異なっても良い。又、2つの隣接するR^4は互いに一緒になってC_1-C_4アルキレンジオキシ基又はハロC_1-C_4アルキレンジオキシ基を示すことができる。

Xは酸素原子、硫黄原子、－NH－で表される基又は単結合を示し、Yは酸素原子又は硫黄原子を示し、mは0～3の整数を示し、nは1～5の整数を示し、pは0又は1を示す。)で表されるフェニルピリジン類又はその塩類及び該化合物を含有する除草剤並びにその使用方法に関する。

発明の効果

[0011] 本発明によれば、高い除草効果を示し、かつ、重要作物に対して十分な安全性を示す除草剤及びそれに用いられる有用な化合物を得ることが出来る。

発明を実施するための最良の形態

[0012] 以下本発明を詳細に説明する。

本発明の一般式(I)で表されるフェニルピリジン類又はその塩類の定義において、「ハロゲン原子」とは塩素原子、臭素原子、沃素原子又はフッ素原子を示す。

「C_1-C_8アルキル基」とは、炭素原子数1～8個の直鎖状、炭素原子数3～8個の分岐鎖状又は脂環式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、シクロプロピル基、1－メチルシクロプロピル基、2－メチルシクロプロピル基、ノルマルブチル基、イソブチル基、セカンダリーブチル基、ターシャリーブチル基、1，2－ジメチルブチル基、シクロブチル基、1－メチルシクロブチル基、シクロプロピルメチル基、ノルマルペンチル基、ネオペンチル基、シクロペンチル基、1－メチルシクロペンチル基、2－メチルシクロペンチル基、ノルマルヘキシル基、シクロヘキシル基、1－メチルシクロヘキシル基、n－オクチル基等が挙げられる。

[0013] 「ハロC_1-C_8アルキル基」とは、同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された炭素原子数1～8個の直鎖状、炭素原子数3～8個の分岐鎖状又は脂環式のアルキル基を示し、例えばクロロメチル基、トリフルオロメチル基、2－クロロエチル基、2－フルオロエチル基、2,2－ジフルオロエチル基、2,2,2－トリフルオロエチル基、2,2,2－トリクロロエチル基、3－クロロプロピル基、3－ブロモプロピル基、3,3,3－トリフルオロプロピル基、2,2,3,3－テトラフルオロプロピル基、2,2,3,3,3－ペン

タフルオロプロピル基、1－メチル－2,2,2－トリフルオロエチル基、2,2,2－トリフルオロ－1－(トリフルオロメチル)エチル基、1－メチル－2,2,3,3,3－ペンタフルオロプロピル基、3－クロロプロピル基、3－ブロモプロピル基、1－フルオロシクロプロピル基、2－フルオロシクロプロピル基、2－トリフルオロメチルシクロプロピル基、2－メチル－2－トリフルオロメチルシクロプロピル基、2－トリフルオロメチルシクロプロピルメチル基、2－メチル－2－トリフルオロメチルシクロプロピルメチル基、4－クロロブチル基、4,4,4－トリフルオロブチル基、2,2,3,3,4,4,4－ヘプタフルオロブチル基、5,5,5－トリフルオロペンチル基、6,6,6－トリフルオロヘキシル基、7－フルオロヘプチル基、8－クロロオクチル基、2,2－ジフルオロシクロプロピル基、(2,2－ジフルオロシクロプロピル)メチル基、2,2－ジクロロシクロプロピル基、(2,2－ジクロロシクロプロピル)メチル基、パーフルオロオクチル基等が挙げられる。

[0014] 「C_2-C_8アルケニル基」とは、炭素原子数2～8個の直鎖状、炭素原子数3～8個の分岐鎖状又は脂環式のアルケニル基を示し、例えば、ビニル基、アリル基、2－ブテニル基、2－メチル－2－プロペニル基、1－メチル－2－プロペニル基、1－メチル－2－ブテニル基、2－メチル－2－ブテニル、2－ペンテニル基、2－ヘキセニル基、2－シクロヘキセニル基等が挙げられる。

「C_2-C_8アルキニル基」とは、炭素原子数2～8個の直鎖状、炭素原子数5～8個の分岐鎖状又は脂環式のアルキニル基を示し、例えば、エチニル基、2－プロピニル基、2－ブチニル基、1－メチル－2－プロピニル基、2－シクロヘキシニル基等が挙げられる。

「C_1-C_8アルコキシ基」とは、炭素原子数1～8個の直鎖アルコキシ基、炭素原子数3～8個の分岐鎖状又は脂環式アルコキシ基を示し、例えば、メトキシ基、エトキシ基、ノルマルプロポキシ基、イソプロポキシ基、シクロプロポキシ基、ノルマルブトキシ基、セカンダリーブトキシ基、ターシャリーブトキシ基、ノルマルペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、ノルマルヘキシルオキシ基、ノルマルオクチルオキシ基等が挙げられる。

[0015] 「ハロC_1-C_8アルコキシ基」とは、同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された炭素原子数1～8個の直鎖アルコキシ基、炭素原子数3～8個の分岐鎖

状又は脂環式アルコキシ基を示し、例えば、クロロメトキシ基、フルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2－クロロエトキシ基、2－フルオロエトキシ基、2,2－ジフルオロエトキシ基、2,2,2－トリフルオロエトキシ基、2,2,2－トリクロロエトキシ基、3－クロロプロポキシ基、3－ブロモプロポキシ基、3,3,3－トリフルオロプロポキシ基、2,2,3,3－テトラフルオロプロポキシ基、2,2,3,3,3－ペンタフルオロプロポキシ基、2, 2－ジフルオロシクロプロポキシ基、2, 2－ジクロロシクロプロポキシ基、1－メチル－2,2,2－トリフルオロエトキシ基、2,2,2－トリフルオロ－1－(トリフルオロメチル)エトキシ基、1－メチル－2,2,3,3,3－ペンタフルオロプロポキシ基、3－クロロプロポキシ基、3－ブロモプロポキシ基、4－クロロブトキシ基、4,4,4－トリフルオロブトキシ基、5, 5, 5－トリフルオロペンチルオキシ基、6, 6, 6－トリフルオロヘキシルオキシ基等を示す。

[0016] 「C_1-C_6アルキルチオ基」とは、炭素原子数1～6個の直鎖アルキル基、炭素原子数3～6個の分岐鎖状又は脂環式アルキル基が硫黄原子に結合した基を示し、例えば、メチルチオ基、エチルチオ基、ノルマルプロピルチオ基、イソプロピルチオ基、シクロプロピルチオ基、ノルマルブチルチオ基、セカンダリーブチルチオ基、ターシャリーブチルチオ基、ノルマルペンチルチオ基、イソペンチルチオ基、ネオペンチルチオ基、シクロペンチルチオ基、ノルマルヘキシルチオ基、ノルマルオクチルチオ基等が挙げられる。

「C_1-C_6アルキルスルフィニル基」とは、炭素原子数1～6個の直鎖アルキル基、炭素原子数3～6個の分岐鎖状又は脂環式アルキル基がスルフィニル基に結合した基を示し、例えば、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、ノルマルプロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、シクロプロピルスルフィニル基、ノルマルブチルスルフィニル基、セカンダリーブチルスルフィニル基、ターシャリーブチルスルフィニル基、ノルマルペンチルスルフィニル基、イソペンチルスルフィニル基、ネオペンチルスルフィニル基、シクロペンチルスルフィニル基、ノルマルヘキシルスルフィニル基、ノルマルオクチルスルフィニル基等が挙げられる。

「C_1-C_6アルキルスルホニル基」とは、炭素原子数1～6個の直鎖アルキル基、炭素原子数3～6個の分岐鎖状又は脂環式アルキル基がスルホニル基に結合した基を示し、例えば、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、ノルマルプロピルスルホニル

基、イソプロピルスルホニル基、シクロプロピルスルホニル基、ノルマルブチルスルホニル基、セカンダリーブチルスルホニル基、ターシャリーブチルスルホニル基、ノルマルペンチルスルホニル基、イソペンチルスルホニル基、ネオペンチルスルホニル基、シクロペンチルスルホニル基、ノルマルヘキシルスルホニル基、ノルマルオクチルスルホニル基等が挙げられる。

「モノC_1-C_6アルキルアミノ基」とは、1個の炭素原子数1～6個のアルキル基で置換されたアミノ基を示し、例えばメチルアミノ基、エチルアミノ基、ノルマルプロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ノルマルブチルアミノ基、イソブチルアミノ基、セカンダリーブチルアミノ基、ターシャリーブチルアミノ基、ノルマルペンチルアミノ基、ノルマルヘキシルアミノ基等を示し、「同一又は異なっても良いジC_1-C_6アルキルアミノ基」とは2個の同一又は異なっても良い炭素原子数1～6個のアルキル基で置換されたアミノ基を示し、例えばジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、メチルエチルアミノ基、メチルノルマルプロピルアミノ基、エチルイソプロピルアミノ基、ジノルマルプロピルアミノ基、ジイソプロピルアミノ基、ジノルマルブチルアミノ基、ノルマルプロピルノルマルブチルアミノ基、メチルノルマルブチルアミノ基、ジイソブチルアミノ基、ジセカンダリーブチルアミノ基、ジターシャリーブチルアミノ基、エチルノルマルペンチルアミノ基、ジノルマルペンチルアミノ基、エチルノルマルヘキシルアミノ基、ジノルマルヘキシルアミノ基等を示し、「C_1-C_6アルキルカルボニル基」とは、炭素原子数1～6個のアルキル基で置換されたカルボニル基を示し、例えばメチルカルボニル基、エチルカルボニル基、ノルマルプロピルカルボニル基、イソプロピルカルボニル基、ノルマルブチルカルボニル基、イソブチルカルボニル基、セカンダリーブチルカルボニル基、ターシャリーブチルカルボニル基、ノルマルペンチルカルボニル基、ノルマルヘキシルカルボニル基等を示す。

[0017] 「複素環基」とは、酸素原子、硫黄原子又は窒素原子から選択される少なくとも1つのヘテロ原子を有する3～8員複素環基を示し、例えば、オキシラン環、オキセタン環、フラン環、ジヒドロフラン環、テトラヒドロフラン環、チオフェン環、ジヒドロチオフェン環、テトラヒドロチオフェン環、ピロール環、ピロリン環、ピロリジン環、ピラン環、ジヒドロピラン環、テトラヒドロピラン環、チアン環、オキサゾール環、イソオキサゾール環、チ

アゾール環、イソチアゾール環、イミダゾール環、トリアゾール環、ピラゾール環、ピリジン環、ピリミジン環、ピリダジン環、ピペリジン環、ピペラジン環、モルホリン環又は1，3－オキサジン環を有する基等が挙げられる。

これらの基が「C_1－C_8アルキル」、「ハロC_1－C_8アルキル」、「ハロC_1－C_8アルコキシ」、「複素環」等として部分を示す場合も上記「C_1－C_8アルキル基」、「ハロC_1－C_8アルキル基」、「ハロC_1－C_8アルコキシ基」、「複素環基」等と同じ意味の部分を示す。又、「C_1－C_5」、「C_1－C_6」等は炭素数1～5、1～6のように炭素数の範囲を示す。

又、「R^1とR^2は一緒になって酸素原子、硫黄原子、窒素原子から選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含む3～8員環」とは、例えば、ピロリン環、ピロリジン環、ピラゾリン環、ピラゾリジン環、オキサゾリン環、オキサゾリジン環、イソオキサゾリン環、イソオキサゾリジン環、チアゾリン環、チアゾリジン環、イソチアゾリン環、イソチアゾリジン環、ピペリジン環、ピペラジン環、モルホリン環等が挙げられる。

[0018] 一般式(I)で表されるフェニルピリジン類において、R^1として好ましくはC_1－C_8アルキル基、ハロC_1－C_8アルキル基、C_2－C_8アルケニル基、ハロC_2－C_8アルケニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、C_1－C_6アルキル基、ハロC_1－C_6アルキル基、C_1－C_6アルコキシ基、ハロC_1－C_6アルコキシ基、シアノ基又はニトロ基から選択される1以上の置換基を有するフェニル基であり、更に好ましくは、C_1－C_5アルキル基、ハロC_1－C_5アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、ハロC_1－C_5アルキル基又はハロC_1－C_5アルコキシ基から選択される1以上の置換基を有するフェニル基である。

R^2として好ましくは水素原子、C_1－C_8アルキル基、C_1－C_8アルコキシC_1－C_8アルキル基、シアノC_1－C_8アルキル基、C_2－C_8アルケニル基、C_2－C_8アルキニル基、C_1－C_8アルキルカルボニル基、ハロC_1－C_8アルキルカルボニル基又はC_2－C_8アルケニルカルボニル基であり、更に好ましくは水素原子、C_1－C_8アルキル基又はC_1－C_8アルキルカルボニル基である。

R^3として好ましくはC_1－C_8アルキル基、ハロC_1－C_8アルキル基、C_2－C_8アルケニル基、ハロC_2－C_8アルケニル基、C_2－C_8アルキニル基、ハロC_2－C_8アルキニル基、C_1－C_8アルコキシ基、ハロC_1－C_8アルコキシ基、ペンタフルオロサルファニル基（－SF_5）、C_1－C_8ア

ルキルチオ基、C_1-C_8アルキルスルフィニル基、C_1-C_8アルキルスルホニル基、モノC_1-C_8アルキルアミノ基又はジC_1-C_8アルキルアミノ基であり、更に好ましくは、C_1-C_5アルキル基、ハロC_1-C_5アルキル基、C_1-C_5アルコキシ基又はハロC_1-C_5アルコキシ基であり、好ましいR^3の置換位置はピリジン環4位である。

[0019] R^4として好ましくはC_1-C_8アルキル基、ハロC_1-C_8アルキル基、C_1-C_8アルコキシC_1-C_8アルキル基、ハロC_1-C_8アルコキシC_1-C_8アルキル基、C_2-C_8アルケニル基、ハロC_2-C_8アルケニル基、C_2-C_8アルキニル基、ハロC_2-C_8アルキニル基、C_1-C_8アルコキシ基、ハロC_1-C_8アルコキシ基、C_1-C_8アルコキシC_1-C_8アルコキシ基、ハロC_1-C_8アルコキシC_1-C_8アルコキシ基、ペンタフルオロサルファニル基(-SF_5)、トリメチルシリル基、C_1-C_8アルキルカルボニルオキシ基、ハロC_1-C_8アルキルカルボニルオキシ基、C_1-C_8アルキルスルホニルアミノ基、ハロC_1-C_8アルキルスルホニルアミノ基、C_1-C_8アルキルカルボニル基、C_1-C_8アルコキシカルボニル基又はハロC_1-C_4アルキレンジオキシ基であり、更に好ましくはハロC_1-C_8アルキル基、ハロC_1-C_8アルコキシC_1-C_8アルキル基、ハロC_1-C_8アルコキシ基又はジフルオロメチレンジオキシ基(-OCF_2O-)である。

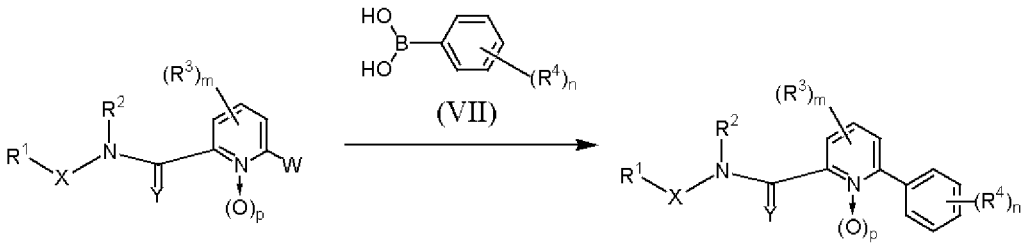
Xとして好ましくは酸素原子又は単結合であり、Yとして好ましくは酸素原子であり、mとして好ましくは1であり、nとして好ましくは1又は2である。

一般式(I)で表されるフェニルピリジン類の塩類としては、酢酸塩、プロピオン酸塩、酪酸塩、シュウ酸塩、アジピン酸塩、ドデカン二酸塩、ラウリン酸塩、ステアリン酸塩、トリフルオロ酢酸塩、フマール酸塩、マレイン酸塩、安息香酸塩、フタル酸塩等のカルボン酸塩類;メタンスルホン酸塩、1，3－プロパンジスルホン酸塩、p－トルエンスルホン酸塩、ドデシルベンゼンスルホン酸塩等のスルホン酸塩類;塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、炭酸塩等の無機酸塩類等が例示できる。

[0020] 一般式(I)で示される本発明のフェニルピリジン類又はその塩類は新規化合物であり、例えば以下の製造方法に従って製造することができる。

製造方法1． スズキカップリング反応による製造

[化2]



(II) (I)

(式中、R^1、R^2、R^3、R^4、X、Y、m、n及びpは前記に同じくし、Wはハロゲン原子、トリフルオロメチルスルホニルオキシ基、メタンスルホニルオキシ基、p－トルエンスルホニルオキシ基等の脱離基を示す。)

[0021] 一般式(II)で表されるピリジン類と一般式(VII)で表されるフェニルボロン酸類とを塩基及び遷移金属触媒の存在下、配位子又は不活性溶媒の存在下若しくは非存在下に反応させることにより一般式(I)で表される化合物を製造することができる。

本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応に直接関与しないものであれば特に限定されず、例えばメタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等のアルコール類;ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類;アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類;クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類;水;酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類;ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類;アセトニトリル、N, N－ジメチルホルムアミド、N－メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、ピリジン等の極性溶媒等を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種類以上を混合して使用することができる。

本反応で使用できる塩基としては、例えば水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物;水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物;炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩;弗化カリウム等の無機塩類;ピリジン、トリエチルアミン等の有機塩基類等を挙げることができ、その使用量は一般式(VII)で表されるフェニルボロン酸類に対して等モル～過剰モルの範囲で適宜選択して反応を行えば良く、好ましくは2倍モル用いるのが良い。

[0022] 本反応で使用できる遷移金属触媒としてはパラジウム炭素、酢酸パラジウム、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウ

ム、トリス(ジベンジルアセトン)パラジウム等のパラジウム化合物類、ビス(トリフェニルホスフィン)ニッケルクロリド及びテトラキス(トリフェニルホスフィン)ニッケル等のニッケル化合物等を挙げることができ、その使用量は一般式(II)で表されるピリジン類に対して0．0001倍モル～等モルの範囲で適宜選択して反応を行えば良く、好ましくは0．0001倍モル～0．2倍モル用いるのが良い。

本反応で使用できる配位子としてはトリフェニルホスフィン、トリトリルホスフィン、トリt－ブチルホスフィン等のホスフィン配位子等を挙げることができ、その使用量は遷移金属触媒に対して0．5倍モル～100倍モルの範囲で適宜選択すれば良く、好ましくは等モル～10倍モルの範囲である。又、配位子を使用しないで反応させることもできる。

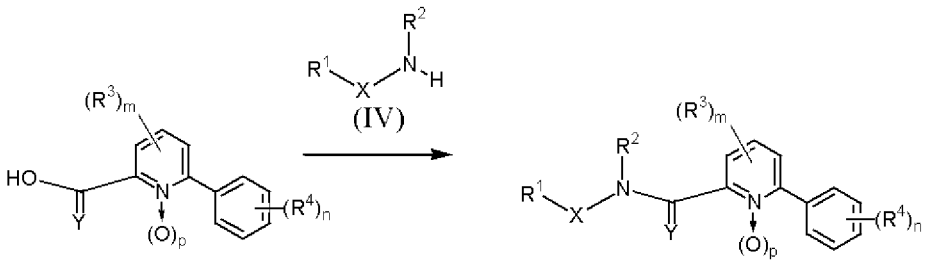
本反応は等モル反応であるので一般式(II)で表されるピリジン類及び一般式(VII)で表されるフェニルボロン酸類を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもでき、好ましくは一般式(VII)で表されるフェニルボロン酸類を過剰に使用するのが良い。

反応温度は－50℃～使用する不活性溶媒の沸点域の範囲で適宜行えば良く、好ましくは室温～120℃の範囲である。反応時間は反応の規模及び反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲である。

[0023] 反応後、目的物である一般式(I)の化合物を単離するには、水に溶解する溶媒を用いた場合は、減圧下溶媒を留去し、水を加えた後、水に不溶のベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素;クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類;酢酸エチル等のエステル類で抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウム、無水硫酸マグネシウム等の乾燥剤で乾燥し、減圧下で溶媒を留去すれば良い。水に不溶の溶媒を用いた場合は、反応混合物に水を加えた後分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウム、無水硫酸マグネシウム等の乾燥剤で乾燥し、減圧下で溶媒を留去すれば良い。溶媒留去後得られた残渣を、再結晶、懸濁洗浄、カラムクロマトグラフィー等で精製すれば目的物である一般式(I)で表される化合物が得られる。

[0024] 製造方法2． カルボン酸類とアミン類との反応による製造

[化3]



(式中、R^1、R^2、R^3、R^4、X、Y、m、n及びpは前記に同じ。)

一般式(III)で表されるカルボン酸と一般式(IV)で表されるアミン類とを塩基及び縮合剤の存在下、不活性溶媒の存在下又は非存在下に反応させることにより一般式(I)で表される化合物を製造することができる。

[0025] 本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応に直接関与しないものであれば特に限定されず、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類;アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類;クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類;水;酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類;ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類;アセトニトリル、N,N－ジメチルホルムアミド、N－メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、ピリジン等の極性溶媒等を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種類以上を混合して使用することができる。

本反応で使用できる塩基としては、例えば水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物;水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物;炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩;弗化カリウム等の無機塩類;ピリジン、DBU、トリエチルアミン等の有機塩基類等を挙げることができ、その使用量は一般式(IV)で表されるアミン類に対して等モル～過剰モルの範囲で適宜選択して反応を行えば良い。

本反応で使用できる縮合剤としてはカルボニルジイミダゾール、ジシクロヘキシルカルボジイミド、ヨウ化2－クロロ－1－メチルピリジニウム等を挙げることができ、その使用量は一般式(III)で表されるカルボン酸に対して等モル～過剰モルの範囲で適宜選択して反応を行えば良い。

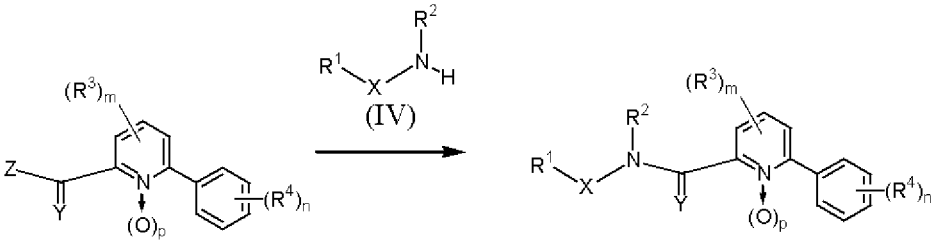
[0026] 本反応は等モル反応であるので一般式(III)で表されるカルボン酸及び一般式(IV)で表されるアミン類を等モル使用すれば良いが、好ましくは一般式(IV)で表されるアミン類を過剰に使用するのが良い。

反応温度は－50℃～使用する不活性溶媒の沸点域の範囲で適宜行えば良く、好ましくは室温～120℃の範囲である。反応時間は反応の規模及び反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲である。

反応後、目的物である一般式(I)の化合物を単離するには、製造方法1に同じくすれば良い。

[0027] 製造方法3. 酸ハライド類とアミン類との反応による製造

[化4]



(式中、R^1、R^2、R^3、R^4、X、Y、m、n及びpは前記に同じくし、Zはハロゲン原子を示す。)

一般式(V)で表される酸ハライドと一般式(IV)で表されるアミン類とを不活性溶媒及び塩基の存在下又は非存在下に反応させることにより一般式(I)で表される化合物を製造することができる。

[0028] 本反応で使用できる不活性溶媒及び塩基としては、製造方法2に同じであり、塩基の使用量は一般に式(V)で表される酸ハライドに対して等モル～過剰モルの範囲で適宜選択して反応を行えば良い。

本反応は等モル反応であるので一般式(V)で表される酸ハライド及び一般式(IV)で表されるアミン類を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもでき、好ましくは一般式(IV)で表されるアミン類を過剰に使用するのが良い。

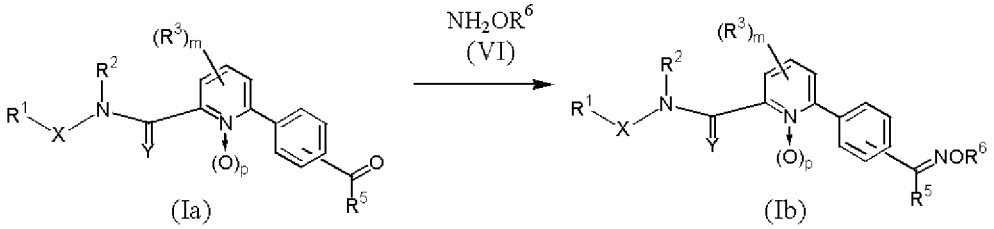
反応温度は－50℃～使用する不活性溶媒の沸点域の範囲で適宜行えば良く、好ましくは0℃～80℃の範囲である。反応時間は反応の規模及び反応温度により一定

しないが、数分～48時間の範囲である。

反応後、目的物である一般式(I)で表される化合物を単離するには、製造方法1に同じくすれば良い。

[0029] 製造方法4. カルボニル化合物とオキシアミン類との反応による製造

[化5]



(式中、R^1、R^2、R^3、R^5、R^6、X、m及びpは前記に同じ。)

一般式(Ia)で表されるカルボニル化合物と一般式(VI)で表されるオキシアミン類又はその酸付加塩類とを不活性溶媒及び塩基の存在下又は非存在下に反応させることにより一般式(Ib)で表される化合物を製造することができる。

[0030] 本反応で使用できる不活性溶媒としては、製造方法1に同じである。

本反応で使用できる塩基としては、製造方法2に同じくし、その使用量は一般に式(VI)で表されるオキシアミン類に対して等モル～過剰モルの範囲で適宜選択して反応を行えば良い。

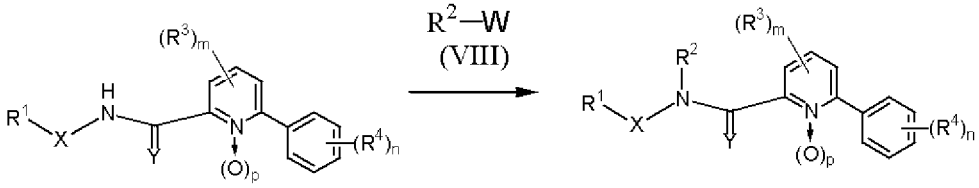
本反応は等モル反応であるので一般式(Ia)で表されるカルボニル化合物及び一般式(VI)で表されるオキシアミン類を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもでき、好ましくは一般式(VI)で表されるオキシアミン類を過剰に使用するのが良い。

反応温度は－50℃～使用する不活性溶媒の沸点域の範囲で適宜行えば良く、好ましくは室温～80℃の範囲である。反応時間は反応の規模及び反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲である。

反応後、目的物である一般式(Ib)の化合物を単離するには、製造方法1に同じくすれば良い。

[0031] 製造方法5. フェニルピリジン類の窒素原子上の水素原子置換反応による製造

[化6]



(Ic) (I)

(式中、R^1、R^2、R^3、R^4、W、X、Y、m、n及びpは前記に同じ。)

一般式(Ic)で表されるフェニルピリジン類と一般式(VIII)で表される化合物とを不活性溶媒及び塩基の存在下又は非存在下に反応させることにより一般式(I)で表される化合物を製造することができる。

[0032] 本反応で使用できる不活性溶媒及び塩基としては、製造方法2に同じであり、塩基の使用量は一般式(VIII)で表される化合物に対して等モル～過剰モルの範囲で適宜選択して反応を行えば良い。

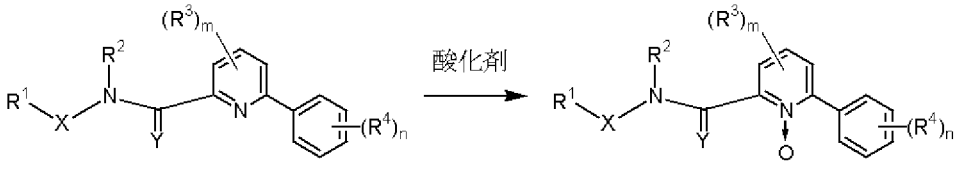
本反応は等モル反応であるので一般式(Ic)で表されるフェニルピリジン類及び一般式(VIII)で表される化合物を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもでき、好ましくは式(VIII)で表される化合物を過剰に使用するのが良い。

反応温度は－50℃～使用する不活性溶媒の沸点域の範囲で適宜行えば良く、好ましくは0℃～100℃の範囲である。反応時間は反応の規模及び反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲である。

反応後、目的物である一般式(I)の化合物を単離するには、製造方法1に同じくすれば良い。

[0033] 製造方法6. ピリジン類の酸化反応による製造

[化7]



(Id) (Ie)

(式中、R^1、R^2、R^3、R^4、X、Y、m、及びnは前記に同じ。)

一般式(Id)で表されるフェニルピリジン類と酸化剤とを不活性溶媒存在下又は非

存在下に反応させることにより一般式(Ie)で表される化合物を製造することができる。

[0034] 本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応に直接関与しないものであれば特に限定されず、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類;アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類;クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類;水;酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類;ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類;アセトニトリル、N,N－ジメチルホルムアミド、N－メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド等の極性溶媒等を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種類以上を混合して使用することができる。

本反応で使用できる酸化剤としてはm－クロロ過安息香酸、過酸化水素、過酢酸等を挙げることができる。

本反応は等モル反応であるので一般式(Id)で表されるフェニルピリジン類及び酸化剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもでき、好ましくは酸化剤を過剰に使用するのが良い。

反応温度は－50℃～使用する不活性溶媒の沸点域の範囲で適宜行えば良く、好ましくは0℃～25℃の範囲である。反応時間は反応の規模及び反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲である。

反応後、目的物である一般式(Ie)で表される化合物を単離するには、製造方法1に同じくすれば良い。

[0035] 中間体である一般式(II)で表される化合物は、例えば、国際公開第00／175112号パンフレット、欧州特許出願公開第0053011号明細書又は欧州特許出願公開第447004号明細書記載の方法に準じて製造できる。

中間体である一般式(III)で表される化合物は、例えば、国際公開第04／014844号パンフレット又は国際公開第04／002948号パンフレット記載の方法に準じて製造できる。

中間体である一般式(IV)で表される化合物は、市販されているものを用いれば良い。

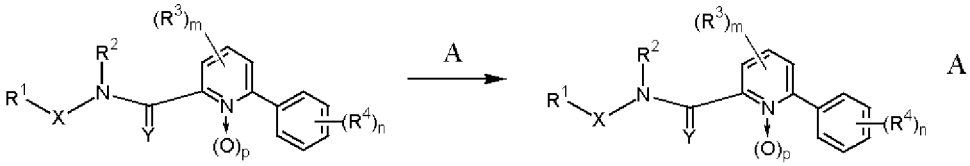
中間体である一般式(V)で表される化合物は、対応する化合物(III)より塩化チオニ

ル等を用いる常法によりハロゲン化して製造できる。

[0036] さらに、本発明のフェニルピリジン類の塩類は以下の方法で製造することができる。

製造方法7.

[化8]



(I) (If)

(式中、R^1、R^2、R^3、R^4、X、Y、m、n及びpは前記に同じくし、Aは無機酸又は有機酸を示す。)

即ち、一般式(I)で表されるフェニルピリジン類と無機酸又は有機酸とを、不活性溶媒存在下又は非存在下に反応させることにより一般式(If)で表される塩類を製造することができる。

[0037] 本反応で使用できる酸としては有機酸、無機酸を用いることが出来、有機酸としては酢酸、プロピオン酸、酪酸、シュウ酸、アジピン酸、ドデカン二酸、ラウリン酸、ステアリン酸、トリフルオロ酢酸、フマール酸、マレイン酸、安息香酸、フタル酸等のカルボン酸類;メタンスルホン酸、1,3－プロパンジスルホン酸、p－トルエンスルホン酸、ドデシルベンゼンスルホン酸等のスルホン酸類等を挙げることができる。無機酸としては塩酸、硫酸、硝酸、炭酸等を挙げることができる。

本反応で使用できる不活性溶媒としては、製造方法6に同じである。

本反応は等モル反応であるので一般式(I)で表されるフェニルピリジン類及び無機酸又は有機酸を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもでき、好ましくは無機酸又は有機酸を過剰に使用するのが良い。

反応温度は－50℃～使用する不活性溶媒の沸点域の範囲で適宜行えば良く、好ましくは0℃～25℃の範囲である。反応時間は反応の規模及び反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲である。

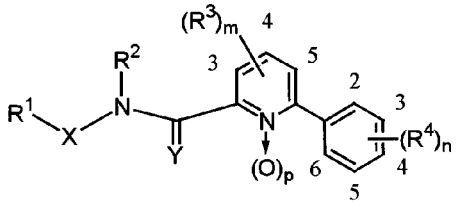
反応後溶媒を減圧留去し、結晶をろ別し、無機酸塩、有機酸塩を製造することが出来る。このままでも十分であるが、更に精製したい場合は上記の不活性溶媒で洗浄

することにより高純度のフェニルピリジン酸付加塩類を製造することが出来る。

[0038] 上記の製造方法に従って製造できる一般式(I)で表される本発明化合物を第1表に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。尚、表中、「n－」はノルマルを、「i－」はイソを、「c－」はシクロを、「－」は単結合を、「＊」は無置換であることを示す。

[0039] [表1]

一般式（I）



（I）

第1表（R^2=H、p=0）

化合物No.	R^1	X	$(R^3)m$	$(R^4)n$	融点(℃)又はnD/(℃)
1-1	4-F-C_6H_4	-	*	3-CF_3O	103-104
1-2	4-F-C_6H_4	-	*	3-CF_3	135-137
1-3	4-F-C_6H_4	-	4-CH_3	3-CF_3O	93-95
1-4	CF_3CH_2	-	4-CH_3	3-CF_3O	73-74
1-5	c-C_3H_5	-	4-CH_3	3-CF_3O	76-78
1-6	c-$C_3H_5CH_2$	-	4-CH_3	3-CF_3O	53-54
1-7	2,4-F_2-C_6H_3	-	4-CH_3	3-CF_3O	102-103
1-8	4-F-C_6H_4	-	4-CH_3O	3-CF_3O	102-103
1-9	CF_3CH_2	-	4-CH_3O	3-CF_3O	87-88
1-10	c-C_3H_5	-	4-CH_3O	3-CF_3O	70-71
1-11	4-F-C_6H_4	-	4-CH_3	2-CF_3O	106-108
1-12	4-F-C_6H_4	-	4-CH_3O	2-CF_3O	124-125
1-13	c-C_3H_5	-	4-CH_3	3-CF_3	105-106
1-14	c-C_3H_5	-	4-CH_3	3-CN	160-162
1-15	CF_3CH_2	-	4-CH_3	3-CF_3	121-122
1-16	CF_3CH_2	-	4-CH_3	3-CN	205-207
1-17	CF_3CH_2	-	4-CH_3O	3-CN	179-181
1-18	4-F-C_6H_4	-	4-CH_3O	3-CN	206-207
1-19	c-C_3H_5	-	4-OH	3-CF_3O	209-210
1-20	4-F-C_6H_4	-	4-CH_3O	2,3-OCF_2O-	149-150
1-21	c-C_3H_5	-	4-CH_3O	2,3-OCF_2O-	142-144

[0040] [表2]

第1表（続き）

化合物No.	R^1	X	$(R^3)m$	$(R^4)n$	融点(℃)又はnD/(℃)
1-22	CF_3CH_2	-	4-CH_3O	2,3-OCF_2O-	146-148
1-23	c-C_3H_5	-	4-CH_3O	3-CN	160-162
1-24	c-C_3H_5	-	4-CH_3O	3-F	59-62
1-25	c-C_3H_5	-	4-CH_3O	3-Cl	121-122
1-26	i-C_3H_7	-	4-CH_3	3-CF_3O	63-64
1-27	t-C_4H_9	-	4-CH_3	3-CF_3O	70-71
1-28	C_2H_5	O	4-CH_3	3-CF_3O	122-123
1-29	4-F-C_6H_4	-	4-CH_3	3-CN	208-210
1-30	4-F-C_6H_4	-	4-CH_3	3-CF_3	137-138
1-31	c-C_3H_5	-	4-CH_3	2,3-OCF_2O-	133-134
1-32	CF_3CH_2	-	4-CH_3	2,3-OCF_2O-	141-142
1-33	4-F-C_6H_4	-	4-CH_3	2,3-OCF_2O-	150-151
1-34	c-C_3H_5	-	4-CH_3O	3-CF_3	105-107
1-35	CF_3CH_2	-	4-CH_3O	3-CF_3	116-117
1-36	4-F-C_6H_4	-	4-CH_3O	3-CF_3	130-131
1-37	c-C_3H_5	-	4-CF_3CH_2O	3-CF_3O	88-89
1-38	CH_3	-	4-CH_3	3-CF_3O	1.5380/23.0
1-39	C_2H_5	-	4-CH_3	3-CF_3O	1.5300/23.0
1-40	n-C_3H_7	-	4-CH_3	3-CF_3O	1.5305/23.0
1-41	n-C_4H_9	-	4-CH_3	3-CF_3O	1.5270/23.0
1-42	CH_3	O	4-CH_3	3-CF_3O	1.5355/23.0
1-43	i-C_3H_7	O	4-CH_3	3-CF_3O	90-91
1-44	4-CF_3O-$C_6H_4CH_2$	-	4-CH_3	3-CF_3O	77-78
1-45	4-Cl-C_6H_4-CH(CH_3)	-	4-CH_3	3-CF_3O	69-70
1-46	4-F-C_6H_4	-	4-CH_3	3-CF_3O	107-108
1-47	C_6H_5	-	4-CH_3	3-CF_3O	84-85
1-48	HC≡CCH_2	-	4-CH_3	3-CF_3O	75-76

[0041] [表3]

第1表（続き）

化合物No.	R^1	X	$(R^3)m$	$(R^4)n$	融点(℃)又はnD/(℃)
1-49	$CH_3OCH_2CH_2$	-	4-CH_3	3-CF_3O	61-62
1-50	c-C_5H_9	-	4-CH_3	3-CF_3O	80-81
1-51	c-C_6H_{11}	-	4-CH_3	3-CF_3O	85-86
1-52	CH_2=$CHCH_2$	-	4-CH_3	3-CF_3O	1.5415/23.0
1-53	s-C_4H_9	-	4-CH_3	3-CF_3O	74-75
1-54	i-C_4H_9	-	4-CH_3	3-CF_3O	40-41
1-55	$CH_3SCH_2C(CH_3)_2$	-	4-CH_3	3-CF_3O	1.5140/23.0
1-56	$CH_3SCH_2CH(CH_3)$	-	4-CH_3	3-CF_3O	1.5470/23.0
1-57	$CH_3SCH_2CH_2$	-	4-CH_3	3-CF_3O	1.5565/23.0
1-58	$CH_3SOCH_2C(CH_3)_2$	-	4-CH_3	3-CF_3O	245-136
1-59	$CH_3SO_2CH_2C(CH_3)_2$	-	4-CH_3	3-CF_3O	147-148
1-60	$CH_3SOCH_2CH(CH_3)$	-	4-CH_3	3-CF_3O	アモルファス
1-61	$CH_3SO_2CH_2CH(CH_3)$	-	4-CH_3	3-CF_3O	166-167
1-62	$CH_3SOCH_2CH_2$	-	4-CH_3	3-CF_3O	106-107
1-63	$CH_3SO_2CH_2CH_2$	-	4-CH_3	3-CF_3O	183-186
1-64	1-CH_3-c-C_3H_4	-	4-CH_3O	3-CF_3O	81-82
1-65	1-CH_3-c-C_3H_4	-	4-CH_3	3-CF_3O	79-81
1-66	1-CH_3-c-C_3H_4	-	4-CH_3	3-CF_3	99-100
1-67	1-CH_3-c-C_3H_4	-	4-OCH_3	3-CF_3	118-119
1-68	c-C_4H_7	-	4-CH_3	3-CF_3O	86-87
1-69	CHF_2CH_2	-	4-CH_3	3-CF_3O	1.5233/23.0
1-70	CH_2FCH_2	-	4-CH_3	3-CF_3O	1.5320/23.0
1-71	CH_2ClCH_2	-	4-CH_3	3-CF_3O	68-69
1-72	i-C_3H_7	-	5-CH_3	3-CF_3O	81-82
1-73	c-C_3H_5	-	5-CH_3	3-CF_3O	77-78
1-74	CF_3CH_2	-	5-CH_3	3-CF_3O	88-89
1-75	4-F-C_6H_4	-	5-CH_3	3-CF_3O	110-111

[0042] [表4]

第1表（続き）

化合物No.	R^1	X	$(R^3)m$	$(R^4)n$	融点(℃)又はnD/(℃)
1-76	C_2H_5	-	4-CH_3O	3-CF_3O	59-60
1-77	n-C_3H_7	-	4-CH_3O	3-CF_3O	56-57
1-78	c-C_4H_7	-	4-CH_3O	3-CF_3O	82-83
1-79	c-C_5H_9	-	4-CH_3O	3-CF_3O	71-72
1-80	$HC\equiv CCH_2$	-	4-CH_3O	3-CF_3O	78-79
1-81	CH_3	O	4-CH_3O	3-CF_3O	89-90
1-82	C_2H_5	O	4-CH_3O	3-CF_3O	90-91
1-83	i-C_3H_7	O	4-CH_3O	3-CF_3O	111-112
1-84	$CF_3CF_2CH_2$	-	4-CH_3	3-CF_3O	73-74
1-85	$CF_3CF_2CF_2CH_2$	-	4-CH_3	3-CF_3O	95-96
1-86	Tetrahydrofurfuryl	-	4-CH_3	3-CF_3O	1.5376/23.0
1-87	Morpholino	-	4-CH_3	3-CF_3O	181-182
1-88	$(CH_3)_2N$	-	4-CH_3	3-CF_3O	1.5362/23.0
1-89	c-C_3H_5	-	4-C_2H_5	3-CF_3O	57-58
1-90	1-CH_3-c-C_3H_4	-	4-C_2H_5	3-CF_3O	82-83
1-91	c-C_3H_5	-	4-C_2H_5O	3-CF_3O	85-86
1-92	1-CH_3-c-C_3H_4	-	4-C_2H_5O	3-CF_3O	74-75
1-93	c-C_3H_5	-	4-Cl	3-CF_3O	112-113
1-94	C_2H_5	-	4-CH_3	3-CF_3	96-97
1-95	i-C_3H_7	-	4-CH_3	3-CF_3	86-87
1-96	c-C_4H_7	-	4-CH_3	3-CF_3	117-118
1-97	c-C_5H_9	-	4-CH_3	3-CF_3	127-128
1-98	CH_3	O	4-CH_3	3-CF_3	96-97
1-99	C_2H_5	O	4-CH_3	3-CF_3	111-112
1-100	i-C_3H_7	O	4-CH_3	3-CF_3	122-123
1-101	Morpholino	-	4-CH_3	3-CF_3	176-177
1-102	$(CH_3)_2N$	-	4-CH_3	3-CF_3	91-92

[0043] [表5]

第1表（続き）

化合物No.	R^1	X	$(R^3)m$	$(R^4)n$	融点(℃)又はnD/(℃)
1-103	C_2H_5	-	4-CH_3O	3-CF_3	91-92
1-104	i-C_3H_7	-	4-CH_3O	3-CF_3	127-128
1-105	c-C_4H_7	-	4-CH_3O	3-CF_3	115-116
1-106	c-C_5H_9	-	4-CH_3O	3-CF_3	98-99
1-107	CH_3	0	4-CH_3O	3-CF_3	99-100
1-108	C_2H_5	0	4-CH_3O	3-CF_3	88-89
1-109	i-C_3H_7	0	4-CH_3O	3-CF_3	90-91
1-110	Morpholino	-	4-CH_3O	3-CF_3	175-176
1-111	$(CH_3)_2N$	-	4-CH_3O	3-CF_3	119-120
1-112	Morpholino	-	4-CH_3O	3-CF_3O	161-162
1-113	$(CH_3)_2N$	-	4-CH_3O	3-CF_3O	74-75
1-114	3-CF_3-C_6H_4	-	4-CH_3	3-CF_3O	115-116
1-115	4-CF_3-C_6H_4	-	4-CH_3	3-CF_3O	162-163
1-116	4-CH_3O-C_6H_4	-	4-CH_3	3-CF_3O	81-82
1-117	4-Br-C_6H_4	-	4-CH_3	3-CF_3O	157-158
1-118	4-Cl-C_6H_4	-	4-CH_3	3-CF_3O	139-140
1-119	4-Cl-3-CH_3-C_6H_3	-	4-CH_3	3-CF_3O	135-136
1-120	4-CF_3O-C_6H_4	-	4-CH_3	3-CF_3O	128-129
1-121	4-CN-C_6H_4	-	4-CH_3	3-CF_3O	192-193
1-122	2,4-Cl_2-C_6H_3	-	4-CH_3	3-CF_3O	129-130
1-123	4-$(CH_3)_2N$-C_6H_4	-	4-CH_3	3-CF_3O	130-131
1-124	4-CF_3S-C_6H_4	-	4-CH_3	3-CF_3O	146-147
1-125	4-CF_3SO-C_6H_4	-	4-CH_3	3-CF_3O	
1-126	4-CF_3SO_2-C_6H_4	-	4-CH_3	3-CF_3O	143-144
1-127	4-CH_3S-C_6H_4	-	4-CH_3	3-CF_3O	99-100
1-128	4-CH_3SO-C_6H_4	-	4-CH_3	3-CF_3O	195-196
1-129	4-CH_3SO_2-C_6H_4	-	4-CH_3	3-CF_3O	156-157

[0044] [表6]

第1表（続き）

化合物No.	R^1	X	$(R^3)m$	$(R^4)n$	融点(℃)又はnD/(℃)
1-130	2-CF_3-c-C_3H_4	-	4-CH_3	3-CF_3O	
1-131	2,2-Cl_2-1-CH_3-c-C_3H_2	-	4-CH_3	3-CF_3O	
1-132	2-CH_3-c-C_3H_4	-	4-CH_3O	3-CF_3O	1.5140/23.0
1-133	1-CH_3-c-C_4H_6	-	4-CH_3	3-CF_3O	
1-134	c-C_3H_5	-	4-CH_3	3-CH_3O	
1-135	1-CH_3-c-C_3H_4	-	4-CH_3	2,3-OCF_2O-	
1-136	1-CH_3-c-C_3H_4	-	4-CH_3O	2,3-OCF_2O-	
1-137	c-C_3H_5	-	4-CH_3	2,3-OCF_2CF_2O-	
1-138	c-C_3H_5	-	4-CH_3O	3-CH_3	
1-139	4-CN-$C_6H_4CH_2$	-	4-CH_3	3-CF_3O	107-108
1-140	4-CN-$C_6H_4CH_2$	-	4-CH_3O	3-CF_3O	123-124
1-141	4-CH_3O-$C_6H_4CH_2$	-	4-CH_3	3-CF_3O	73-74
1-142	4-CH_3O-$C_6H_4CH_2$	-	4-CH_3O	3-CF_3O	57-58

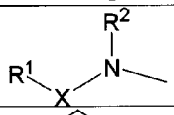
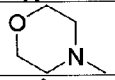
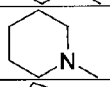
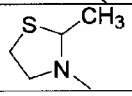
[0045] [表7]

第2表（R^4=3-OCF_3、Y=0、p=0）

化合物No.	R^1	X	R^2	$(R^3)m$	融点(℃)又はnD/(℃)
2-1	CH_3	-	CH_3	4-CH_3	低融点固体
2-2	C_2H_5	0	CH_3	4-CH_3	93-95
2-3	CH_3	-	CH_3	4-CH_3O	65-66
2-4	C_2H_5	0	CH_3	4-CH_3O	54-55
2-5	C_2H_5	-	CH_3	4-CH_3	48-49
2-6	c-C_3H_5	-	CH_3	4-CH_3O	63-64
2-7	c-C_3H_5	-	CH_3CO	4-CH_3O	1.5370/23.0
2-8	c-C_3H_5	-	CH_3CO_2	4-CH_3O	1.5332/23.0
2-9	c-C_3H_5	-	i-$C_3H_7CO_2$	4-CH_3O	1.5182/23.0

[0046] [表8]

第３表（R^4=3-OCF_3、Y=0、p=0）

化合物No.		(R^3)m	融点(℃)又はnD/(℃)
3-1		4-CH_3	105-106
3-2		4-CH_3	53-54
3-3		4-CH_3	76-77
3-4		4-CH_3	1.5750/23.0
3-5		4-CH_3	1.5607/23.0

[0047] 本発明の一般式(I)で表されるフェニルピリジン類又はその塩類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、本発明の一般式(I)で表されるフェニルピリジン類又はその塩類は、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、乳懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、ジャンボ剤、パック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、固体の担体になり得る材料としては、例えば植物質粉末類(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等)、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、ピロフィライト等}、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、天然鉱物質類(例えばイオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、アタパルジャイトおよびゼオライト等)、レンガ粉砕物、フライアッシュ、砂、プラスチック担体等(例えばポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン等)、炭酸カルシウム、燐酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、硫安、燐安、硝安、尿素、塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以上の混合物の形で使用される。

[0048] 液体の担体になり得る材料としては、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有効成分化合物を分散させ得ることとなるものから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できるが、これらは単独で若しくは2種以上の混合物の形で使用され、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)、エステル類(例えば酢酸エチル、ジイソプピルフタレート、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る。

他の補助剤としては次に例示する代表的な補助剤を挙げることができ、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。有効成分化合物の乳化、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。

[0049] 又、有効成分化合物の分散安定化、粘着及び/又は結合の目的のために、次に例示する補助剤を使用することもでき、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、キサンタンガム、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次に挙げる補助剤を使用することもでき、例えばワックス、ステアリン酸塩、燐酸アルキルエステル等の補助剤を使用できる。

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、縮合燐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、例えばシリコーン油等の補助剤を使用することもできる。

有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ特に制限されないが、その配合割合は0．001～90重量%程度である。例えば、粉剤或いは粒剤とする場合の有効成分化合物の配合割合は0．01～50重量%程度が好ましく、より好ましくは0．1～10重量%程度である。また、乳剤、水和剤或いは顆粒水和剤等とする場合の有効成分化合物の配合割合は0．01～90重量%程度が好ましく、より好ましくは0．1～60重量%程度である。

[0050] 本発明の一般式(I)で表されるフェニルピリジン類又はその塩類を含有する製剤を水で希釈して施用する場合、付着性や拡展性等を向上させ、除草効果を高めるために、散布液中に展着剤等の補助剤を添加しても良い。使用される展着剤等の補助剤としては、界面活性剤(前記の非イオン系界面活性剤、カチオン系界面活性剤、アニオン系界面活性剤、両性系界面活性剤)、パラフィン、ポリ酢酸ビニル、ポリアクリル酸塩、エチレングリコール、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、クロップオイル(鉱物油、動植物油等)、液体肥料等が挙げられる。これらの補助剤は、必要に応じて2種以上を同時に使用しても良い。展着剤等の補助剤の使用量は、その種類によって異なるが、通常、散布液中に0．01～5重量%を添加するのが適当である。又、補助剤の種類によっては、製剤中の成分としてあらかじめ添加しておくことも可能である。

本発明の一般式(I)で表されるフェニルピリジン類又はその塩類を有効成分とする除草剤の施用量は、化合物の構造や対象雑草、処理時期、処理方法、土壌の性質等の条件によって異なるが、通常、1ヘクタール当りの有効成分量としては2～2000g、好ましくは5～1000gの範囲が適当である。

[0051] 本発明の除草剤の対象雑草としては、畑地においては、例えば、シロザ、アカザ、イヌタデ、ハルタデ、イヌビユ、アオビユ、ハコベ、ホトケノザ、イチビ、オナモミ、マルバアサガオ、チョウセンアサガオ、セイヨウカラシナ、ヤエムグラ、セイヨウスミレ、オロシャギク、コセンダングサ等の広葉雑草、メヒシバ、オヒシバ、イヌビエ、エノコログサ等

の狭葉雑草が挙げられる。又、水田においては、例えば、キカシグサ、アゼナ、コナギ、アブノメ、ミゾハコベ、ヘラオモダカ、オモダカ、ウリカワ等の広葉雑草、タイヌビエ、タマガヤツリ、イヌホタルイ、ミズガヤツリ等の狭葉雑草が挙げられる。本発明の除草剤は、畑地および水田において、土壌処理、茎葉処理又は湛水処理のいずれの処理方法によっても上記雑草を防除することが可能である。

本発明の除草剤の適用作物としては、例えば、トウモロコシ、コムギ、オオムギ、イネ、ダイズ等が挙げられ、これらの作物に対し、土壌処理および茎葉処理のいずれにおいても影響が少なく、これらの作物の栽培において選択的除草剤として使用することが可能である。又、本発明の除草剤は、例えば、トウモロコシ、コムギ、オオムギ、イネ、ダイズ等の遺伝形質を改良し薬剤耐性等を付与した作物に対し、土壌処理及び茎葉処理のいずれにおいても影響が少なく、これらの作物の栽培において選択的除草剤として使用することが可能である。

本発明の除草剤は、同一分野に用いる殺虫剤、殺菌剤、植物成長調節剤等の他の農薬、及び肥料等と混合施用することができる。又、除草効果をより安定化させるために他の除草剤と混合施用することもできる。本発明の一般式(I)で表されるフェニルピリジン類と他の除草剤を混合施用する場合、両者の各々の製剤を施用時に混合しても良いが、あらかじめ両者を含有する製剤として施用しても良い。上記目的で好適に混合施用することができる除草剤としては、例えば以下のものが挙げられる。

[0052] グリホサート及びその塩、グリホシネート及びその塩、ビアラホス及びその塩、ブタミホス、アニロホス、ベンスリド等の有機リン系除草剤、スルファレート、ジアレート、トリアレート、EPTC、ブチレート、エスプロカルブ、チオベンカルブ(ベンチオカーブ)、モリネート、イソポリネート、ジメピペレート、ピリブチカルブ、フェンメディファム、クロルプロファム、アシュラム等のカーバメート系除草剤、ジウロン、リニュロン、フルオメツロン、ジフェノキスロン、ダイムロン、イソプロツロン、イソウロン、テブチウロン、メタベンズチアズロン、メトベンズロン、クロロトルロン等のウレア系除草剤、メタザクロール、アラクロール、ブタクロール、プレチラクロール、アセトクロール、メトラクロール、テニルクロール、ジエタチル、ジメテナミド、プロパニル、ジフルフェニカン、メフェナセット、フルフェナセット、ブロモブチド、イソキサベン(ベンザミゾール)等のアミド系除草剤、トリフルラ

リン、ベンフルラリン、プロジアミン、オリザリン、ブトラリン、ペンディメタリン等のジニトロアニリン系除草剤、

[0053] 2，4－D及びその誘導体、2，4，5－T及びその誘導体、MCPA及びその誘導体、ジクロプロップ及びその誘導体、メコプロップ及びその誘導体、MCPB及びその誘導体、ジカンバ及びその誘導体、2，3，6－TBA及びその誘導体、キンクロラック及びその誘導体、キンメラック及びその誘導体、クロピラリド及びその誘導体、ピクロラム及びその誘導体、トリクロピル及びその誘導体、フルロキシピル及びその誘導体、ベナゾリン及びその誘導体、ジクロホップ及びその誘導体、フルアジホップ及びその誘導体、ハロキシホップ及びその誘導体、フェノキサプロップ及びその誘導体、キザロホップ及びその誘導体、クロジナホップ及びその誘導体、シハロホップ及びその誘導体等のカルボン酸系除草剤、ブロモキシニル及びその誘導体、アイオキシニル及びその誘導体、ジノテルブ及びその誘導体等のフェノール系除草剤、アロキシジム及びその塩、セトキシジム、シクロキシジム、トラルコキシジム、ブトロキシジム、クレトジム、テプラロキシジム、スルコトリオン、メソトリオン、ベンゾビシクロン等のシクロヘキサンジオン系除草剤、

[0054] クロルニトロフェン、クロメトキシニル、オキシフルオルフェン、ビフェノックス、アシフルオルフェン及びその塩、フルオログリコフェン、ラクトフェン、ホメサフェン、アクロニフェン等のジフェニルエーテル系除草剤、アミドスルフロン、クロリムロンエチル、スルホメッロンメチル、プリミスルフロン、ベンスルフロンメチル、エトキシスルフロン、シクロスルファムロン、クロルスルフロン、メトスルフロンメチル、トリベニュロンメチル、トリアスルフロン、シノスルフロン、エタメトスルフロンメチル、トリフルスルフロンメチル、プロスルフロン、チフェンスルフロンメチル、ピラゾスルフロンエチル、ハロスルフロンメチル、フラザスルフロン、リムスルフロン、ニコスルフロン、フルピルスルフロン及びその塩、イマゾスルフロン、スルホスルフロン、ヨードスルフロン、トリトスルフロン、メソスルフロン等のスルホニルウレア系除草剤、パラコート、ジクワット等のビピリジニウム系除草剤、ピラゾレート、ピラゾキシフェン、ベンゾフェナップ等のピラゾール系除草剤、シマジン、アトラジン、シアナジン、シメトリン、ジメタメトリン、トリアジフラム、メトリブジン等のトリアジン系除草剤、イマザメタベンズ、イマザピル及びその塩、イマザキン及びその塩、イ

マゼタピル及びその塩、イマザモックス及びその塩等のイミダゾリノン系除草剤、

[0055] その他の除草剤として、インダノファン、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、カフェンストロール、フェントラザミド、スルフェントラゾン、カルフェントラゾンエチル、ペントキサゾン、オキサジアゾン、オキサジアルギル、ピラフルフェンエチル、イソプロパゾール、フルポキサム、クロマゾン、イソキサフルトール、イソキサクロルトール、ジチオピル、チアゾピル、ピリチオバック及びその塩、ピリミノバックメチル、ビスピリバック及びその塩、ブロマシル、ターバシル、レナシル、フルプロパシル、オキサジクロメホン、シンメチリン、クロルフタリム、フルミクロラックペンチル、フルミオキサジン、シニドンエチル、アザフェニジン、フルチアセットメチル、フルメツラム、メトスラム、クロランスラムメチル、ベンフレセート、エトフメセート、ベンタゾン、ピラクロニル、ベフルブタミド、ピコリナフェン、フロラスラム、プロポキシカルバゾン、フルカルバゾン及びその塩、シニドンエチル、ピノキサベン等が挙げられる。

実施例

[0056] 以下本発明を実施例、製造例及び試験例によりさらに具体的に説明するが本発明はその要旨を超えない限りこれらの実施例、製造例ならびに試験例に限定されることはない。

実施例1. N－(4－フルオロフェニル)－4－メチル－6－(3－トリフルオロメトキシフェニル)ピリジン－2－カルボキサミド(化合物No. 1－3)の製造

窒素気流下、6－クロロ－N－(4－フルオロフェニル)－4－メチルピリジン－2－カルボキサミド(0. 30g、1. 13ミリモル)、3－トリフルオロメトキシフェニルボロン酸(0. 28g、1. 36ミリモル)、2M炭酸ナトリウム水溶液(1. 5ml、3. 0ミリモル)とトルエン(3. 0ml)の混合物を70℃に昇温後、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム(0. 10g、0. 087ミリモル)を加え、加熱還流下で3時間撹拌した。反応混合物に水(20ml)を加え、酢酸エチルで抽出後、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を減圧流去後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製した後、得られた結晶をヘキサンで洗浄し、目的物0. 31gを得た。

収率:70. 3%

物性:融点 93～95℃

[0057] 以下に本発明の代表的な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。

製剤例1.

本発明化合物 10部

キシレン 70部

N－メチルピロリドン 10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 10部

以上を均一に混合溶解して乳剤とする。

製剤例2.

本発明化合物 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。

[0058] 製剤例3.

本発明化合物 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。

製剤例4.

本発明化合物 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

以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

[0059] 試験例1. 出芽前の水田雑草に対する除草効果試験

75cm^{2}のプラスチックポットに土壌(埴壌土)を充填し、水田雑草であるイヌホタルイの種子を播種し、コナギ、アゼナ、ミゾハコベの種子を混和した土壌75cm^{3}で覆土し

た後、水深5cmの状態に湛水した。翌日に、製剤例1～4に準じて調製した本発明化合物を有効成分とする薬剤の所定有効薬量(g／ha)を水で希釈し水面に滴下処理をした。ついで、温室内で育成し、処理28日後に除草効果を調査し、無処理と比較して下記の基準に従って除草効果を評価した。

除草効果の判定基準

0・・・0%の除草効果

1・・・1%～39%の除草効果

2・・・40%～69%の除草効果

3・・・70%～89%の除草効果

4・・・90%以上の除草効果

結果を第4表に示す。尚、表中「－」は試験未実施を表す。

[0060] [表9]

第４表

化合物 Ｎｏ.	薬量 (g/ha)	ｲﾇﾎﾀﾙｲ	ｱｾﾞﾅ	ｺﾅｷﾞ	ﾐｿﾞﾊｺﾍﾞ
1-1	1000	1	4	4	4
1-2	1000	1	4	4	4
1-3	1000	2	4	4	4
1-4	1000	4	4	4	4
1-5	1000	4	4	4	4
1-6	1000	4	4	4	4
1-7	1000	1	4	4	4
1-8	1000	2	4	4	4
1-9	1000	4	4	4	4
1-10	1000	4	4	4	4
1-11	1000	1	4	4	4
1-12	1000	1	4	4	4
1-13	1000	3	4	4	4
1-14	1000	4	2	4	4
1-15	1000	2	4	4	4
1-16	1000	1	2	4	4
1-17	1000	2	4	4	4
1-18	1000	1	4	4	4
1-19	1000	-	-	-	-
1-20	1000	1	4	4	4
1-21	1000	4	4	4	4
1-22	1000	3	4	4	4
1-23	1000	3	4	4	4
1-24	1000	2	4	4	4
1-25	1000	4	4	4	4
1-26	1000	4	4	4	4
1-27	1000	-	-	-	-
1-28	1000	4	4	4	4
1-29	1000	-	-	-	-
1-30	1000	-	-	-	-
1-31	1000	4	4	4	4
1-32	1000	3	4	4	4

[0061] [表10]

第４表（続き）

化合物 Ｎｏ.	薬量 (g/ha)	ｲﾇﾎﾀﾙｲ	ｱｾﾞﾅ	ｺﾅｷﾞ	ﾐｿﾞﾊｺﾍﾞ
1-33	1000	-	-	-	-
1-34	1000	4	4	4	4
1-35	1000	4	4	4	4
1-36	1000	-	-	-	-
1-37	1000	-	-	-	-
1-38	1000	-	-	-	-
1-39	1000	-	-	-	-
1-40	1000	-	-	-	-
1-41	1000	-	-	-	-
1-42	1000	-	-	-	-
1-43	1000	4	4	4	4
1-44	1000	-	-	-	-
1-45	1000	-	-	-	-
1-46	1000	-	-	-	-
1-47	1000	4	4	4	4
1-48	1000	-	-	-	-
1-49	1000	-	-	-	-
1-50	1000	2	4	4	4
1-51	1000	1	4	4	4
1-52	1000	-	-	-	-
1-53	1000	4	4	4	4
1-54	1000	-	-	-	-
1-55	1000	-	-	-	-
1-56	1000	1	1	4	4
1-57	1000	-	-	-	-
1-58	1000	-	-	-	-
1-59	1000	-	-	-	-
1-60	1000	-	-	-	-
1-61	1000	-	-	-	-
1-62	1000	-	-	-	-
1-63	1000	-	-	-	-
1-64	1000	3	4	4	4

[0062] [表11]

第４表（続き）

化合物 Ｎｏ.	薬量 (g/ha)	ｲﾇﾎﾀﾙｲ	ｱｾﾞﾅ	ｺﾅｷﾞ	ﾐｿﾞﾊｺﾍﾞ
1-65	1000	4	4	4	4
1-66	1000	4	3	4	4
1-67	1000	3	4	4	4
1-68	300	4	4	4	4
1-69	1000	-	-	-	-
1-70	300	1	4	4	4
1-71	300	1	4	4	4
1-72	1000	-	-	-	-
1-73	1000	-	-	-	-
1-74	1000	-	-	-	-
1-75	1000	-	-	-	-
1-76	1000	4	4	4	4
1-77	1000	4	4	4	4
1-78	1000	4	4	4	4
1-79	1000	4	4	4	4
1-80	1000	4	4	4	4
1-81	1000	4	4	4	4
1-82	1000	4	4	4	4
1-83	1000	4	4	4	4
1-84	1000	-	-	-	-
1-85	1000	-	-	-	-
1-86	1000	-	-	-	-
1-87	300	2	4	4	4
1-88	300	1	4	4	4
1-89	1000	-	-	-	-
1-90	1000	-	-	-	-
1-91	1000	-	-	-	-
1-92	1000	-	-	-	-
1-93	1000	-	-	-	-
1-94	1000	-	-	-	-
1-95	1000	-	-	-	-
1-96	1000	-	-	-	-

[0063] [表12]

第４表（続き）

化合物 Ｎｏ.	薬量 (g/ha)	ｲﾇﾎﾀﾙｲ	ｱｾﾞﾅ	ｺﾅｷﾞ	ﾐｿﾞﾊｺﾍﾞ
1-97	1000	-	-	-	-
1-98	1000	-	-	-	-
1-99	1000	-	-	-	-
1-100	1000	-	-	-	-
1-101	1000	-	-	-	-
1-102	1000	-	-	-	-
1-103	1000	-	-	-	-
1-104	1000	-	-	-	-
1-105	1000	-	-	-	-
1-106	1000	-	-	-	-
1-107	1000	-	-	-	-
1-108	1000	-	-	-	-
1-109	1000	-	-	-	-
1-110	1000	-	-	-	-
1-111	1000	-	-	-	-
2-1	1000	-	-	-	-
2-2	1000	-	-	-	-
2-3	300	1	4	4	4
2-4	1000	4	4	4	4
2-5	1000	-	-	-	-
3-1	1000	-	-	-	-
3-2	1000	-	-	-	-
3-3	300	2	4	4	4
3-4	300	2	4	4	4
3-5	300	1	4	4	4

[0064] 試験例2．出芽後の水田雑草に対する除草効果試験。

75cm^{2}のプラスチックポットに土壌（埴壌土）を充填し、水田雑草であるイヌビエ、イヌホタルイの種子を播種しアゼナ、ミゾハコベの種子を混和した土壌75cm^{3}で覆土した後、水深5cmの状態に湛水し、温室内で育成した。供試植物が子葉期から一葉期の時期に、本発明化合物を有効成分とする薬剤を所定有効薬量（g／ha）の薬液として処理をした。ついで、温室内で育成し、処理28日後に除草効果を調査し、試験例1の基準に従って除草効果を評価した。結果を第5表に示す。

[0065] [表13]

第５表

化合物 Ｎｏ.	薬量 (g/ha)	ｲﾇﾋﾞｴ	ｲﾇﾎﾀﾙｲ	ｱｾﾞﾅ	ﾐｿﾞﾊｺﾍﾞ
1-1	1000	2	1	4	4
1-2	1000	2	1	2	4
1-3	1000	4	2	4	4
1-4	1000	4	3	4	4
1-5	1000	4	4	4	4
1-6	1000	4	2	4	4
1-7	1000	3	1	4	4
1-8	1000	1	1	4	4
1-9	1000	4	4	4	4
1-10	1000	4	4	4	4
1-11	1000	2	4	4	4
1-12	1000	2	1	4	4
1-13	1000	4	4	3	4
1-14	1000	4	4	2	4
1-15	1000	2	1	2	4
1-16	1000	2	1	4	4
1-17	1000	3	4	2	4
1-18	1000	1	4	4	4
1-19	1000	-	-	-	-
1-20	1000	1	4	4	4
1-21	1000	4	4	4	4
1-22	1000	4	4	4	4
1-23	1000	4	4	3	4
1-24	1000	3	3	3	4
1-25	1000	4	4	4	4
1-26	1000	4	4	4	4
1-27	1000	-	-	-	-
1-28	1000	4	4	4	4
1-29	1000	-	-	-	-
1-30	1000	-	-	-	-
1-31	1000	4	4	4	4
1-32	1000	4	2	3	4

[0066] [表14]

第５表（続き）

化合物 Ｎｏ.	薬量 (g/ha)	ｲﾇﾋﾞｴ	ｲﾇﾎﾀﾙｲ	ｱｾﾞﾅ	ﾐｿﾞﾊｺﾍﾞ
1-33	1000	-	-	-	-
1-34	1000	4	4	4	4
1-35	1000	4	3	3	4
1-36	1000	-	-	-	-
1-37	1000	-	-	-	-
1-38	1000	-	-	-	-
1-39	1000	-	-	-	-
1-40	1000	-	-	-	-
1-41	1000	-	-	-	-
1-42	1000	-	-	-	-
1-43	1000	4	4	4	4
1-44	1000	-	-	-	-
1-45	1000	-	-	-	-
1-46	1000	-	-	-	-
1-47	1000	4	3	4	4
1-48	1000	-	-	-	-
1-49	1000	-	-	-	-
1-50	1000	4	4	4	4
1-51	1000	4	2	2	4
1-52	1000	-	-	-	-
1-53	1000	4	4	4	4
1-54	1000	-	-	-	-
1-55	1000	-	-	-	-
1-56	1000	2	2	2	4
1-57	1000	-	-	-	-
1-58	1000	-	-	-	-
1-59	1000	-	-	-	-
1-60	1000	-	-	-	-
1-61	1000	-	-	-	-
1-62	1000	-	-	-	-
1-63	1000	-	-	-	-
1-64	1000	4	2	4	4

[0067] [表15]

第５表（続き）

化合物 Ｎｏ.	薬量 (g/ha)	ｲﾇﾋﾞｴ	ｲﾇﾎﾀﾙｲ	ｱｾﾞﾅ	ﾐｿﾞﾊｺﾍﾞ
1-65	1000	-	4	4	4
1-66	1000	-	2	2	4
1-67	1000	-	3	3	4
1-68	300	4	4	4	4
1-69	1000	-	-	-	-
1-70	300	3	2	4	4
1-71	1000	2	2	1	4
1-72	1000	-	-	-	-
1-73	1000	-	-	-	-
1-74	1000	-	-	-	-
1-75	1000	-	-	-	-
1-76	1000	4	4	4	4
1-77	1000	4	4	4	4
1-78	1000	4	4	4	4
1-79	1000	4	4	4	4
1-80	300	2	3	4	4
1-81	300	4	2	4	4
1-82	1000	4	4	4	4
1-83	1000	4	4	4	4
1-84	1000	-	-	-	-
1-85	1000	-	-	-	-
1-86	1000	-	-	-	-
1-87	300	-	2	4	4
1-88	300	-	1	4	4
1-89	1000	-	-	-	-
1-90	1000	-	-	-	-
1-91	1000	-	-	-	-
1-92	1000	-	-	-	-
1-93	1000	-	-	-	-
1-94	1000	-	-	-	-
1-95	1000	-	-	-	-
1-96	1000	-	-	-	-

[0068] [表16]

第５表（続き）

化合物 Ｎｏ.	薬量 (g/ha)	ｲﾇﾋﾞｴ	ｲﾇﾎﾀﾙｲ	ｱｾﾞﾅ	ﾐｿﾞﾊｺﾍﾞ
1-97	1000	-	-	-	-
1-98	1000	-	-	-	-
1-99	1000	-	-	-	-
1-100	1000	-	-	-	-
1-101	1000	-	-	-	-
1-102	1000	-	-	-	-
1-103	1000	-	-	-	-
1-104	1000	-	-	-	-
1-105	1000	-	-	-	-
1-106	1000	-	-	-	-
1-107	1000	-	-	-	-
1-108	1000	-	-	-	-
1-109	1000	-	-	-	-
1-110	1000	-	-	-	-
1-111	1000	-	-	-	-
2-1	1000	-	-	-	-
2-2	1000	-	-	-	-
2-3	300	2	1	4	4
2-4	300	2	2	4	4
2-5	1000	-	-	-	-
3-1	1000	-	-	-	-
3-2	1000	-	-	-	-
3-3	300	1	1	2	4
3-4	300	1	1	1	4
3-5	300	1	1	4	4

[0069] 試験例3. 畑地茎葉処理試験

面積200cm^{2}の樹脂製バットに洪積性埴壌土の畑土壌を充填し、施肥後、ハコベ、スミレ、イヌカミツレ、ヤエムグラ及びコムギを播種し、均一に覆土を行った。その後、温室で栽培管理を続け、供試雑草の生育葉令が1.0～2.0葉期に達した時、本発明化合物を有効成分とする薬剤を、有効成分量の処理薬量が1アール当たり1gとなるように均一に噴霧処理した。その後、温室内で栽培管理を続け、薬剤処理後21日目に除草効果又は薬害について調査を行った。結果を第6表に示した。

尚、除草効果又は薬害の評価は下記数式により除草率を求め、下記の基準による除草効果係数又は薬害係数で表した。

[0070] [数1]

$$\text{除草率又は薬害率}\ (\%) = \left(1 - \frac{\text{処理区における雑草の地上部生体重}}{\text{無処理区における雑草の地上部生体重}}\right) \times 100$$

[0071] 除草効果係数又は薬害係数　除草率又は薬害率(%)

0・・・・・・・・・・0～20

1・・・・・・・・・・21～39

2・・・・・・・・・・40～69

3・・・・・・・・・・70～89

4・・・・・・・・・・90～99

5・・・・・・・・・・100

[0072] [表17]

第６表

化合物Ｎｏ.	除草効果				薬害
	ﾊｺﾍﾞ	ｽﾐﾚ	ｲﾇｶﾐﾂﾚ	ﾔｴﾑｸﾞﾗ	ｺﾑｷﾞ
1-1	-	-	-	-	-
1-2	-	-	-	-	-
1-3	4	5	5	5	0
1-4	3	4	2	2	0
1-5	3	4	1	4	0
1-6	3	4	1	4	0
1-7	3	4	3	3	0
1-8	3	4	1	4	0
1-9	4	4	2	4	0
1-10	4	5	3	4	1
1-11	3	3	1	2	0
1-12	3	4	1	3	0
1-13	2	3	1	3	0
1-14	2	3	1	2	0
1-15	2	2	1	2	0
1-16	-	-	-	-	-
1-17	1	2	1	0	0
1-18	2	3	1	1	0
1-19	-	-	-	-	-
1-20	3	4	2	3	0
1-21	4	4	3	4	1
1-22	4	4	4	4	1
1-23	3	4	1	2	0
1-24	2	3	1	2	0
1-25	3	4	1	4	0
1-26	2	4	2	4	1
1-27	2	4	1	2	0
1-28	2	4	1	2	0
1-29	2	4	1	2	0
1-30	3	4	4	4	1
1-31	2	4	2	4	1
1-32	3	4	3	4	0

[0073] [表18]

第６表（続き）

化合物Ｎｏ.	除草効果				薬害
	ﾊｺﾍﾞ	ｽﾐﾚ	ｲﾇｶﾐﾂﾚ	ﾔｴﾑｸﾞﾗ	ｺﾑｷﾞ
1-33	3	4	3	3	0
1-34	4	4	1	4	1
1-35	3	4	2	2	0
1-36	3	4	3	4	1
1-37	-	-	-	-	-
1-38	2	2	1	2	0
1-39	2	4	1	4	0
1-40	3	4	1	4	1
1-41	2	4	1	3	0
1-42	2	3	0	2	0
1-43	2	5	1	3	1
1-44	-	-	-	-	-
1-45	-	-	-	-	-
1-46	-	-	-	-	-
1-47	2	3	2	4	0
1-48	2	5	0	2	0
1-49	-	-	-	-	-
1-50	3	3	2	4	1
1-51	2	4	2	2	1
1-52	2	4	1	1	0
1-53	3	4	3	4	1
1-54	3	4	2	4	1
1-55	-	-	-	-	-
1-56	-	-	-	-	-
1-57	-	-	-	-	-
1-58	-	-	-	-	-
1-59	-	-	-	-	-
1-60	-	-	-	-	-
1-61	-	-	-	-	-
1-62	-	-	-	-	-
1-63	-	-	-	-	-
1-64	3	5	2	3	0

[0074] [表19]

第６表（続き）

化合物Ｎｏ.	除草効果				薬害
	ﾊｺﾍﾞ	ｽﾐﾚ	ｲﾇｶﾐﾂﾚ	ﾔｴﾑｸﾞﾗ	ｺﾑｷﾞ
1-65	3	4	1	3	0
1-66	2	4	0	0	0
1-67	2	4	0	1	0
1-68	3	5	2	4	1
1-69	4	4	0	4	0
1-70	3	4	0	2	0
1-71	3	4	0	2	0
1-72	-	-	-	-	-
1-73	-	-	-	-	-
1-74	-	-	-	-	-
1-75	-	-	-	-	-
1-76	-	-	-	-	-
1-77	-	-	-	-	-
1-78	2	3	1	4	0
1-79	3	3	0	4	0
1-80	-	-	-	-	-
1-81	-	-	-	-	-
1-82	-	-	-	-	-
1-83	-	-	-	-	-
1-84	1	4	2	1	0
1-85	1	3	2	1	0
1-86	-	-	-	-	-
1-87	3	4	0	3	0
1-88	2	2	1	2	0
1-89	2	3	2	3	0
1-90	5	4	2	4	0
1-91	5	4	3	4	1
1-92	5	4	2	4	0
1-93	-	-	-	-	-
1-94	-	-	-	-	-
1-95	-	-	-	-	-
1-96	-	-	-	-	-

[0075] [表20]

第６表（続き）

化合物Ｎｏ.	除草効果				薬害
	ﾊｺﾍﾞ	ｽﾐﾚ	ｲﾇｶﾐﾂﾚ	ﾔｴﾑｸﾞﾗ	ｺﾑｷﾞ
1-97	-	-	-	-	-
1-98	-	-	-	-	-
1-99	-	-	-	-	-
1-100	-	-	-	-	-
1-101	-	-	-	-	-
1-102	-	-	-	-	-
1-103	-	-	-	-	-
1-104	-	-	-	-	-
1-105	-	-	-	-	-
1-106	-	-	-	-	-
1-107	-	-	-	-	-
1-108	-	-	-	-	-
1-109	-	-	-	-	-
1-110	-	-	-	-	-
1-111	-	-	-	-	-
2-1	2	4	0	3	0
2-2	3	4	0	3	0
2-3	-	-	-	-	-
2-4	-	-	-	-	-
2-5	-	-	-	-	-
3-1					
3-2					
3-3	2	0	0	2	0
3-4	4	2	1	3	0
3-5	2	2	0	2	0

[0076] 試験例4. 畑地土壌処理試験

面積200cm2の樹脂製バットに洪積性埴壌土の畑土壌を充填し、施肥後、ノスズメノテッポウ、ハコベ、スミレ、イヌカミツレ、及びコムギを播種し、均一に覆土を行った。本発明化合物を有効成分とする薬剤を、有効成分量の処理薬量が1アール当たり3gとなるように土壌表面に均一に噴霧処理した。その後、温室内で栽培管理を続け、薬剤処理後21日目に除草効果について調査を行い、試験例3と同様にして除草効果係数及び薬害係数を求めた。その結果を第7表に示した。

[0077] [表21]

第7表

化合物No.	除草効果				薬害
	ﾉｽｽﾞﾒﾉﾃｯﾎﾟｳ	ﾊｺﾍﾞ	ｽﾐﾚ	ｲﾇｶﾐﾂﾚ	ｺﾑｷﾞ
1-1	-	-	-	-	-
1-2	-	-	-	-	-
1-3	3	5	3	4	0
1-4	4	5	4	5	0
1-5	4	5	5	4	0
1-6	4	4	4	2	0
1-7	3	5	3	5	0
1-8	2	3	3	3	0
1-9	4	5	4	4	0
1-10	4	5	5	3	0
1-11	2	2	2	1	0
1-12	1	2	1	1	0
1-13	2	3	4	3	0
1-14	1	3	5	2	0
1-15	3	3	5	3	0
1-16	-	-	-	-	-
1-17	1	5	3	1	0
1-18	1	2	3	2	0
1-19	-	-	-	-	-
1-20	3	2	3	3	0
1-21	3	5	4	5	0
1-22	4	5	4	5	0
1-23	3	5	4	3	0
1-24	1	3	3	3	0
1-25	1	3	4	2	0
1-26	4	5	5	5	0
1-27	2	3	3	2	0
1-28	3	3	5	3	0
1-29	1	3	3	3	0
1-30	4	4	3	5	0
1-31	1	3	4	3	0

[0078] [表22]

第７表（続き）

化合物Ｎｏ.	除草効果				薬害
	ﾉｽｽﾞﾒﾉﾃｯﾎﾟｳ	ﾊｺﾍﾞ	ｽﾐﾚ	ｲﾇｶﾐﾂﾙ	ｺﾑｷﾞ
1-32	4	5	5	5	1
1-33	1	2	1	3	0
1-34	4	5	4	3	0
1-35	2	5	4	4	0
1-36	3	5	3	5	0
1-37	-	-	-	-	-
1-38	2	5	5	3	0
1-39	4	5	5	4	0
1-40	4	5	5	4	1
1-41	4	5	5	3	0
1-42	2	5	5	4	0
1-43	4	5	5	5	2
1-44	-	-	-	-	-
1-45	-	-	-	-	-
1-46	-	-	-	-	-
1-47	4	5	4	3	0
1-48	1	2	2	2	0
1-49	-	-	-	-	-
1-50	4	4	5	3	0
1-51	3	5	4	3	0
1-52	3	5	4	2	0
1-53	5	5	5	5	0
1-54	5	5	5	5	0
1-55	-	-	-	-	-
1-56	-	-	-	-	-
1-57	-	-	-	-	-
1-58	-	-	-	-	-
1-59	-	-	-	-	-
1-60	-	-	-	-	-
1-61	-	-	-	-	-
1-62	-	-	-	-	-

[0079] [表23]

第７表（続き）

化合物Ｎｏ.	除草効果				薬害
	ﾉｽｽﾞﾒﾉﾃｯﾎﾟｳ	ﾊｺﾍﾞ	ｽﾐﾚ	ｲﾇｶﾐﾂﾚ	ｺﾑｷﾞ
1-63	-	-	-	-	-
1-64	2	5	5	2	0
1-65	2	5	5	2	0
1-66	0	3	4	1	0
1-67	0	3	3	1	0
1-68	3	5	5	2	0
1-69	2	5	5	3	0
1-70	0	5	5	2	0
1-71	0	2	3	2	0
1-72	-	-	-	-	-
1-73	-	-	-	-	-
1-74	-	-	-	-	-
1-75	-	-	-	-	-
1-76	-	-	-	-	-
1-77	-	-	-	-	-
1-78	2	5	5	2	0
1-79	1	3	4	1	0
1-80	-	-	-	-	-
1-81	-	-	-	-	-
1-82	-	-	-	-	-
1-83	0	3	4	1	0
1-84	2	3	4	5	0
1-85	0	0	3	1	0
1-86	-	-	-	-	-
1-87	1	5	5	3	0
1-88	0	2	3	0	0
1-89	3	3	5	3	0
1-90	4	4	4	2	0
1-91	3	5	5	3	0
1-92	3	5	4	4	0
1-93	-	-	-	-	-

[0080] [表24]

第７表（続き）

化合物Ｎｏ.	除草効果				薬害
	ﾉｽｽﾞﾒﾉﾃｯﾎﾟｳ	ﾊｺﾍﾞ	ｽﾐﾚ	ｲﾇｶﾐﾂﾙ	ｺﾑｷﾞ
1-94	－	－	－	－	－
1-95	－	－	－	－	－
1-96	－	－	－	－	－
1-97	－	－	－	－	－
1-98	－	－	－	－	－
1-99	－	－	－	－	－
1-100	－	－	－	－	－
1-101	－	－	－	－	－
1-102	－	－	－	－	－
1-103	－	－	－	－	－
1-104	－	－	－	－	－
1-105	－	－	－	－	－
1-106	－	－	－	－	－
1-107	－	－	－	－	－
1-108	－	－	－	－	－
1-109	－	－	－	－	－
1-110	－	－	－	－	－
1-111	－	－	－	－	－
2-1	2	5	3	2	0
2-2	3	5	5	3	0
2-3	－	－	－	－	－
2-4	－	－	－	－	－
2-5	－	－	－	－	－
3-1	－	－	－	－	－
3-2	－	－	－	－	－
3-3	0	1	1	0	0
3-4	0	2	0	1	0
3-5	0	2	1	2	0

[0081] 本発明を特定の態様を参照して詳細に説明したが、本発明の精神と範囲を離れることなく様々な変更および修正が可能であることは、当業者にとって明らかである。

なお、本出願は、2004年7月12日付けで出願された日本特許出願（特願2004－204466）に基づいており、その全体が引用により援用される。

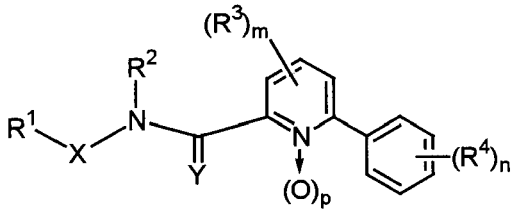
産業上の利用可能性

[0082] 本発明によれば、高い除草効果を示し、かつ、重要作物に対して十分な安全性を示す除草剤及びそれに用いられる有用な化合物を得ることが出来る。

請求の範囲

[1] 一般式(I)

[化1]



(I)

(式中、R^1はC_1-C_8アルキル基、ハロC_1-C_8アルキル基、C_2-C_8アルケニル基、ハロC_2-C_8アルケニル基、C_2-C_8アルキニル基、ハロC_2-C_8アルキニル基、C_1-C_6アルコキシC_1-C_6アルキル基、C_1-C_6アルキルチオC_1-C_6アルキル基、C_1-C_6アルキルスルフィニルC_1-C_6アルキル基、C_1-C_6アルキルスルホニルC_1-C_6アルキル基、モノC_1-C_6アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC_1-C_6アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、アミノ基、SH基、C_1-C_6アルキル基、ハロC_1-C_6アルキル基、C_2-C_6アルケニル基、ハロC_2-C_6アルケニル基、C_2-C_6アルキニル基、ハロC_2-C_6アルキニル基、C_1-C_6アルコキシ基、ハロC_1-C_6アルコキシ基、C_1-C_6アルキルチオ基、ハロC_1-C_6アルキルチオ基、C_2-C_6アルケニルチオ基、ハロC_2-C_6アルケニルチオ基、C_1-C_6アルキルスルフィニル基、ハロC_1-C_6アルキルスルフィニル基、C_1-C_6アルキルスルホニル基、ハロC_1-C_6アルキルスルホニル基、C_1-C_6アルキルカルボニル基、ハロC_1-C_6アルキルカルボニル基、フェニルカルボニル基、C_1-C_6アルコキシカルボニル基、モノC_1-C_6アルキルアミノ基又は同一若しくは異なって良いジC_1-C_6アルキルアミノ基から選択される1～5個の置換基を有する置換フェニル基、フェニルC_1-C_8アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、アミノ基、SH基、C_1-C_6アルキル基、ハロC_1-C_6アルキル基、C_2-C_6アルケニル基、ハロC_2-C_6アルケニル基、C_2-C_6アルキニル基、ハロC_2-C_6アルキニル基、C_1-C_6アルコキシ基、ハロC_1-C_6アルコキシ基、C_1-C_6アルキルチオ基、ハロC_1-C_6アルキルチオ基、C_2-C_6アルケニルチオ基、ハロC_2-C_6アルケニルチオ基、C_1-C_6アルキルスルフィニル基、ハロC_1-C_6アルキルスルフィニル基、C_1-C_6アルキルスル

ホニル基、ハロC_1-C_6アルキルスルホニル基、C_1-C_6アルキルカルボニル基、ハロC_1-C_6アルキルカルボニル基、フェニルカルボニル基、C_1-C_6アルコキシカルボニル基、モノC_1-C_6アルキルアミノ基又は同一若しくは異なって良いジC_1-C_6アルキルアミノ基から選択される1～5個の置換基を環上に有する置換フェニルC_1-C_8アルキル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、アミノ基、SH基、C_1-C_6アルキル基、ハロC_1-C_6アルキル基、C_2-C_6アルケニル基、ハロC_2-C_6アルケニル基、C_2-C_6アルキニル基、ハロC_2-C_6アルキニル基、C_1-C_6アルコキシ基、ハロC_1-C_6アルコキシ基、C_1-C_6アルキルチオ基、ハロC_1-C_6アルキルチオ基、C_2-C_6アルケニルチオ基、ハロC_2-C_6アルケニルチオ基、C_1-C_6アルキルスルフィニル基、ハロC_1-C_6アルキルスルフィニル基、C_1-C_6アルキルスルホニル基、ハロC_1-C_6アルキルスルホニル基、C_1-C_6アルキルカルボニル基、ハロC_1-C_6アルキルカルボニル基、フェニルカルボニル基、C_1-C_6アルコキシカルボニル基、モノC_1-C_6アルキルアミノ基又は同一若しくは異なって良いジC_1-C_6アルキルアミノ基から選択される1～5個の置換基を有する置換複素環基、複素環C_1-C_8アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、アミノ基、SH基、C_1-C_6アルキル基、ハロC_1-C_6アルキル基、C_2-C_6アルケニル基、ハロC_2-C_6アルケニル基、C_2-C_6アルキニル基、ハロC_2-C_6アルキニル基、C_1-C_6アルコキシ基、ハロC_1-C_6アルコキシ基、C_1-C_6アルキルチオ基、ハロC_1-C_6アルキルチオ基、C_2-C_6アルケニルチオ基、ハロC_2-C_6アルケニルチオ基、C_1-C_6アルキルスルフィニル基、ハロC_1-C_6アルキルスルフィニル基、C_1-C_6アルキルスルホニル基、ハロC_1-C_6アルキルスルホニル基、C_1-C_6アルキルカルボニル基、ハロC_1-C_6アルキルカルボニル基、フェニルカルボニル基、C_1-C_6アルコキシカルボニル基、モノC_1-C_6アルキルアミノ基又は同一若しくは異なって良いジC_1-C_6アルキルアミノ基から選択される1～5個の置換基を環上に有する置換複素環C_1-C_8アルキル基を示す。 R^2は水素原子、C_1-C_8アルキル基、C_2-C_8アルケニル基、C_2-C_8アルキニル基、C_1-C_8アルコキシC_1-C_8アルキル基、シアノC_1-C_8アルキル基、C_1-C_8アルキルカルボニル基、ハロC_1-C_8アルキルカルボニル基、C_2-C_8アルケニルカルボニル基又はC_1-C_8アルコキシカルボニル基を示す。又、R^1とR^2は一緒になって酸素原子、硫黄原子、窒素原子から選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含む3～8員環

を形成することができる。 R^3はハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、ペンタフルオロサルファニル基(－SF_5)、C_1-C_8アルキル基、ハロC_1-C_8アルキル基、C_2-C_8アルケニル基、ハロC_2-C_8アルケニル基、C_2-C_8アルキニル基、ハロC_2-C_8アルキニル基、C_1-C_8アルコキシ基、ハロC_1-C_8アルコキシ基、C_1-C_8アルコキシカルボニル基、C_1-C_8アルキルチオ基、C_1-C_8アルキルスルフィニル基、C_1-C_8アルキルスルホニル基、C_1-C_8アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジC_1-C_8アルキルアミノ基を示す。ただし、R^3は、複数の場合には、同一又は異なっても良い。 R^4はハロゲン原子、C_1-C_8アルキル基、ハロC_1-C_8アルキル基、C_2-C_8アルケニル基、ハロC_2-C_8アルケニル基、C_2-C_8アルキニル基、ハロC_2-C_8アルキニル基、C_1-C_8アルコキシ基、ハロC_1-C_8アルコキシ基、C_1-C_8アルコキシC_1-C_8アルキル基、ハロC_1-C_8アルコキシC_1-C_8アルキル基、C_1-C_8アルコキシC_1-C_8アルコキシ基、ハロC_1-C_8アルコキシC_1-C_8アルコキシ基、C_1-C_8アルキルスルホニルアミノ基、ハロC_1-C_8アルキルスルホニルアミノ基、C_1-C_8アルキルチオ基、ハロC_1-C_8アルキルチオ基、C_1-C_8アルキルスルフィニル基、ハロC_1-C_8アルキルスルフィニル基、C_1-C_8アルキルスルホニル基、ハロC_1-C_8アルキルスルホニル基、C_1-C_8アルキルカルボニル基、C_1-C_8アルコキシカルボニル基、C_1-C_8アルキルカルボニルオキシ基、ハロC_1-C_8アルキルカルボニルオキシ基、水酸基、ホルミル基、シアノ基、ニトロ基、同一又は異なっても良いトリC_1-C_8アルキルシリル基、ペンタフルオロサルファニル基(－SF_5)又は－C(R^5)＝NOR^6(式中、R^5及びR^6は同一又は異なっても良く、水素原子、C_1-C_5アルキル基又はハロC_1-C_5アルキル基を示す。)で表される基を示す。ただし、R^4は、複数の場合には、同一又は異なっても良い。又、2つの隣接するR^4は互いに一緒になってC_1-C_4アルキレンジオキシ基又はハロC_1-C_4アルキレンジオキシ基を示すことができる。 Xは酸素原子、硫黄原子、－NH－で表される基又は単結合を示し、Yは酸素原子又は硫黄原子を示し、mは0～3の整数を示し、nは1～5の整数を示し、pは0又は1を示す。)で表されるフェニルピリジン類又はその塩類。

[2] R^1がC_1-C_8アルキル基、ハロC_1-C_8アルキル基、モノC_1-C_6アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC_1-C_6アルキルアミノ基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、C_1-C_6アルキル基、ハロC_1-C_6アルキル基、C_1-C_6アルコキシ基、

ハロC_1-C_6アルコキシ基から選択される1～5個の置環基で置換された置換フェニル基であり、R^2が水素原子、C_1-C_8アルキル基、C_1-C_8アルコキシカルボニル基又はC_1-C_8アルキルカルボニル基であり、R^3がC_1-C_8アルキル基又はC_1-C_8アルコキシ基であり、R^4がC_1-C_8アルキル基、ハロC_1-C_8アルキル基、C_1-C_8アルコキシ基、ハロC_1-C_8アルコキシ基、シアノ基、ジフルオロメチレンジオキシ基（－OCF_2O－）又はテトラフルオロエチレンジオキシ基（－OCF_2CF_2O－）であり、Yが酸素原子である請求項1記載のフェニルピリジン類又はその塩類。

[3] mが1である請求項1又は2いずれか1項記載のフェニルピリジン類又はその塩類。

[4] R^4がハロC_1-C_5アルキル基、ハロC_1-C_5アルコキシ基又はジフルオロメチレンジオキシ基（－OCF_2O－）である請求項1乃至3いずれか1項記載のフェニルピリジン類又はその塩類。

[5] 請求項1乃至4いずれか1項記載のフェニルピリジン類又はその塩類を有効成分として含有する除草剤。

[6] 請求項5記載の除草剤の有効量を土壌又は植物に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/JP2005/012781

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
Int.Cl[7] C07D213/81, A01N43/40, C07D213/89, 405/04, 405/12, 417/06

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)
Int.Cl[7] C07D213/81, A01N43/40, C07D213/89, 405/04, 405/12, 417/06

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 practicable, search terms used)
CAOLD(STN), CAplus(STN), REGISTRY(STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	WO 2003/011853 A1 (DOW AGROSCIENCES, LLC), 13 February, 2003 (13.02.03), Full text; particularly, Claims 1, 4, 7, 8; pages 4 to 6; compound 264 & WO 2003/011853 C1 & CA 2453623 AA & US 2003/114311 A1 & US 6784137 B2 & EP 1414814 A1 & EP 1414814 B1 & BR 2002011532 A & CN 1551876 A & JP 2005-505523 A	1,2,4-6 3

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ 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 application or patent 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
08 August, 2005 (08.08.05)	23 August, 2005 (23.08.05)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office Facsimile No.	Authorized officer Telephone No.

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (January 2004)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2005/012781

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	JP 09-503747 A (BASF AG.), 15 April, 1997 (15.04.97), Full text; particularly, Claim 1 & DE 4323916 A1 & CA 2167290 AA & CA 2167291 AA & WO 95/02580 A2 & WO 95/02580 A3 & WO 95/02590 A2 & WO 95/02590 A3 & AU 9473853 A1 & AU 680676 B2 & AU 9474922 A1 & AU 678594 B2 & BR 9407038 A & BR 9407039 A & EP 708756 A1 & EP 708756 B1 & EP 708769 A1 & EP 708769 B1 & CN 1127504 A & CN 1127507 A & HU 73735 A2 & HU 216344 B & HU 73728 A2 & HU 216439 B & JP 09-503748 A & AT 231855 E & AT 296804 E & ZA 9405170 A & ZA 9405171 A & US 5783522 A & US 6165941 A & FI 9600181 A & FI 9600182 A & NO 9600171 A & NO 9600172 A	1,2,4-6 3
P,X	JP 2004-203871 A (Yamanouchi Pharmaceutical Co., Ltd.), 22 July, 2004 (22.07.04), Full text; for example, example 15 (Family: none)	1,4
X	JP 2003-064057 A (Yamanouchi Pharmaceutical Co., Ltd.), 05 March, 2003 (05.03.03), Full text; for example, example 212 & WO 2002/102778 A1 & CA 2448298 AA & EP 1396487 A1 & CN 1516691 A & BR 2002010030 A & US 2004/192701 A1	1,4
X	JP 56-104883 A (Tanabe Seiyaku Co., Ltd.), 20 August, 1981 (20.08.81), Full text; for examples, example 6 (Family: none)	1,3
X	JP 56-115784 A (Tanabe Seiyaku Co., Ltd.), 11 September, 1981 (11.09.81), Full text; for example, example 14(1) & EP 34349 A2 & EP 34349 A3 & EP 34349 B1 & JP 63-014716 B2 & US 4332809 A	1,3
X	JP 56-007782 A (Tanabe Seiyaku Co., Ltd.), 27 January, 1981 (27.01.81), Full text; for example, referential example 2, compound Nos. (1) to (19) & JP 63-020234 B2	1,3

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2005/012781

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP 2003-206280 A (Takeda Chemical Industries, Ltd.), 22 July, 2003 (22.07.03), Full text; particularly, referential example 10 (Family: none)	1
X	SENGA, Keitaro et al., New syntheses of pyrido[3,2-d]pyrimidines. (1), Journal of Heterocyclic Chemistry, 1982, Vol.19, No.4, p.805-8, full text, particularly, compounds (IXc), (IXe)	1,3
A	JP 2003-528893 A (BASF AG.), 30 September, 2003 (30.09.03) & WO 2001/074157 A2 & WO 2001/074157 A3 & CA 2404353 AA & AU 2001065857 A5 & US 2002/028747 A1 & US 6645911 B2 & EP 1267612 A1 & EP 1267612 B1 & BR 2001009821 A & NZ 521599 A & EP 1464223 A1 & AT 281073 E & ES 2231509 T3 & BG 107158 A & ZA 2002008902 A	1-6
A	JP 2003-511395 A (BASF AG.), 25 March, 2003 (25.03.03) & WO 2001/026466 A2 & WO 2001/026466 A3 & CA 2382619 AA & EP 1220609 A2 & EP 1220609 B1 & TR 200201005 T2 & EE 200200196 A & EP 1369039 A1 & EP 1369039 B1 & AT 255332 E & NZ 529840 A & NZ 529841 A & NZ 529842 A & NZ 529843 A & NZ 518168 A & ES 2211636 T3 & EP 1486119 A1 & AT 286656 E & US 6451733 B1 & NO 2002001685 A & BG 106604 A	1-6
A	JP 2003-503427 A (BASF AG.), 28 January, 2003 (28.01.03) & WO 2001/001777 A1 & US 6348434 B1 & CA 2373764 AA & BR 2000012036 A & EP 1194036 A1 & EP 1194036 B1 & NZ 516228 A & AU 781074 B2 & AT 293882 E & BG 106318 A & ZA 2002000817 A	1-6
A	US 6660692 B1 (AVENTIS CROPSCIENCE S.A.), 09 December, 2003 (09.12.03) & WO 2000/078147 A1 & CA 2371875 AA & EP 1189510 A1 & EP 1189510 B1 & EP 1346638 A1 & AT 250854 E & PT 1189510 T & ES 2208359 T3 & AU 777913 B2	1-6

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2005/012781

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2000/075112 A1 (Kureha Chemical Industry Co., Ltd.), 14 December, 2000 (14.12.00) (Family: none)	1-6
A	GB 2277930 A (SHELL INTERNATIONALE RESEARCH MAATSCHAPPIJ B.V.), 16 November, 1994 (16.11.94) (Family: none)	1-6
A	WO 2001/009098 A1 (Kureha Chemical Industry Co., Ltd.), 08 February, 2001 (08.02.01) (Family: none)	1-6
A	JP 10-512250 A (BASF AG.), 24 November, 1998 (24.11.98) & DE 19500911 A1 & CA 2209482 AA & WO 96/21646 A1 & AU 9644366 A1 & EP 802903 A1 & EP 802903 B1 & CN 1168135 A & BR 9606761 A & AT 170842 E & ZA 9600240 A & US 5747422 A	1-6
A	JP 07-309865 A (American Cyanamid Co.), 28 November, 1995 (28.11.95) & EP 254951 A2 & EP 254951 A3 & EP 254951 B1 & AT 128129 E & ES 2076927 T3 & CA 1337422 A1 & BR 8703877 A & JP 63-088177 A & JP 08-002897 B2 & US 5334576 A & JP 2866028 B2	1-6
A	JP 60-142949 A (American Cyanamid Co.), 29 July, 1985 (29.07.85) & EP 142718 A & DE 3441637 A & AU 8435688 A & DK 8405516 A & ZA 8409045 A & BR 8405908 A & HU 37403 T & DD 229123 A & ES 8603422 A & ES 8604727 A & ES 8605238 A & EP 142718 B & US 4719303 A & IL 73481 A & IL 85526 A & CA 1268463 A & JP 91-070695 B2 & DE 3441637 C2	1-6

国際調査報告

国際出願番号 PCT／JP2005／012781

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））

Int.Cl.[7] C07D213/81, A01N43/40, C07D213/89, 405/04, 405/12, 417/06

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.[7] C07D213/81, A01N43/40, C07D213/89, 405/04, 405/12, 417/06

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）

CAOLD(STN), 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 A	WO 2003/011853 A1(DOW AGROSCIENCES, LLC)2003.02.13, 文献全体、特に、請求項１、４、７、８、第４－６頁、化合物２６４参照 & WO 2003/011853 C1 & CA 2453623 AA & US 2003/114311 A1 & US 6784137 B2 & EP 1414814 A1 & EP 1414814 B1 & BR 2002011532 A & CN 1551876 A & JP 2005-505523 A	１，２，４－６ ３

☑ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ 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の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	国際調査報告の発送日
０８．０８．２００５	23.8.2005

国際調査機関の名称及びあて先	特許庁審査官（権限のある職員）
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	４Ｐ ９５５０ 谷尾 忍 電話番号 ０３－３５８１－１１０１ 内線 ３４９２

様式ＰＣＴ／ＩＳＡ／２１０（第２ページ）（２００４年１月）

Ｃ（続き）．　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
	（Ｃ欄の続きその１）	
Ｘ Ａ	JP 09-503747 A(ビーエーエスエフ　アクチェンゲゼルシャフト)1997.04.15, 文献全体、特に、請求項１参照 & DE 4323916 A1 & CA 2167290 AA & CA 2167291 AA & WO 95/02580 A2 & WO 95/02580 A3 & WO 95/02590 A2 & WO 95/02590 A3 & AU 9473853 A1 & AU 680676 B2 & AU 9474922 A1 & AU 678594 B2 & BR 9407038 A & BR 9407039 A & EP 708756 A1 & EP 708756 B1 & EP 708769 A1 & EP 708769 B1 & CN 1127504 A & CN 1127507 A & HU 73735 A2 & HU 216344 B & HU 73728 A2 & HU 216439 B & JP 09-503748 A & AT 231855 E & AT 296804 E & ZA 9405170 A & ZA 9405171 A & US 5783522 A & US 6165941 A & FI 9600181 A & FI 9600182 A & NO 9600171 A & NO 9600172 A	１，２，４－６ ３
ＰＸ	JP 2004-203871 A(山之内製薬株式会社)2004.07.22, 文献全体、例えば、実施例１５等参照(ファミリーなし)	１，４
Ｘ	JP 2003-064057 A(山之内製薬株式会社)2003.03.05, 文献全体、例えば、実施例２１２等参照 & WO 2002/102778 A1 & CA 2448298 AA & EP 1396487 A1 & CN 1516691 A & BR 2002010030 A & US 2004/192701 A1	１，４
Ｘ	JP 56-104883 A(田辺製薬株式会社)1981.08.20, 文献全体、例えば、実施例６等参照(ファミリーなし)	１，３
Ｘ	JP 56-115784 A(田辺製薬株式会社)1981.09.11, 文献全体、例えば、実施例１４（１）等参照 & EP 34349 A2 & EP 34349 A3 & EP 34349 B1 & JP 63-014716 B2 & US 4332809 A	１，３
Ｘ	JP 56-007782 A(田辺製薬株式会社)1981.01.27, 文献全体、例えば、参考例２の化合物Ｎｏ．（１）－（１９）等参照 & JP 63-020234 B2	１，３
Ｘ	JP 2003-206280 A(武田薬品工業株式会社)2003.07.22, 文献全体、特に、参考例１０参照(ファミリーなし)	１
Ｘ	SENGA, Keitaro et al., New syntheses of pyrido[3,2-d]pyrimidines. (1), Journal of Heterocyclic Chemistry, 1982, vol.19, no,4, p.805-8, 文献全体、特に、化合物（ＩＸｃ）、（ＩＸｅ）等参照	１，３
	（Ｃ欄の続きその２へ続く）	

C（続き）．　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
	（C欄の続きその２）	
A	JP 2003-528893 A(ビーエーエスエフ　アクチェンゲゼルシャフト)2003.09.30 & WO 2001/074157 A2 & WO 2001/074157 A3 & CA 2404353 AA & AU 2001065857 A5 & US 2002/028747 A1 & US 6645911 B2 & EP 1267612 A1 & EP 1267612 B1 & BR 2001009821 A & NZ 521599 A & EP 1464223 A1 & AT 281073 E & ES 2231509 T3 & BG 107158 A & ZA 2002008902 A	1-6
A	JP 2003-511395 A(ビーエーエスエフ　アクチェンゲゼルシャフト)2003.03.25 & WO 2001/026466 A2 & WO 2001/026466 A3 & CA 2382619 AA & EP 1220609 A2 & EP 1220609 B1 & TR 200201005 T2 & EE 200200196 A & EP 1369039 A1 & EP 1369039 B1 & AT 255332 E & NZ 529840 A & NZ 529841 A & NZ 529842 A & NZ 529843 A & NZ 518168 A & ES 2211636 T3 & EP 1486119 A1 & AT 286656 E & US 6451733 B1 & NO 2002001685 A & BG 106604 A	1-6
A	JP 2003-503427 A(ビーエーエスエフ　アクチェンゲゼルシャフト)2003.01.28 & WO 2001/001777 A1 & US 6348434 B1 & CA 2373764 AA & BR 2000012036 A & EP 1194036 A1 & EP 1194036 B1 & NZ 516228 A & AU 781074 B2 & AT 293882 E & BG 106318 A & ZA 2002000817 A	1-6
A	US 6660692 B1(AVENTIS CROPSCIENCE S.A.)2003.12.09 & WO 2000/078147 A1 & CA 2371875 AA & EP 1189510 A1 & EP 1189510 B1 & EP 1346638 A1 & AT 250854 E & PT 1189510 T & ES 2208359 T3 & AU 777913 B2	1-6
A	WO 2000/075112 A1(呉羽化学工業株式会社)2000.12.14(ファミリーなし)	1-6
A	GB 2277930 A(SHELL INTERNATIONALE RESEARCH MAATSCHAPPIJ B.V.)1994.11.16(ファミリーなし)	1-6
A	WO 2001/009098 A1(呉羽化学工業株式会社)2001.02.08(ファミリーなし)	1-6
	（C欄の続きその３へ続く）	

C（続き）．　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
	（C欄の続きその３）	
A	JP 10-512250 A(ビーエーエスエフ　アクチェンゲゼルシャフト)1998.11.24 & DE 19500911 A1 & CA 2209482 AA & WO 96/21646 A1 & AU 9644366 A1 & EP 802903 A1 & EP 802903 B1 & CN 1168135 A & BR 9606761 A & AT 170842 E & ZA 9600240 A & US 5747422 A	1-6
A	JP 07-309865 A(アメリカン・サイアナミド・カンパニー)1995.11.28 & EP 254951 A2 & EP 254951 A3 & EP 254951 B1 & AT 128129 E & ES 2076927 T3 & CA 1337422 A1 & BR 8703877 A & JP 63-088177 A & JP 08-002897 B2 & US 5334576 A & JP 2866028 B2	1-6
A	JP 60-142949 A(アメリカン・サイアナミド・カンパニー)1985.07.29 & EP 142718 A & DE 3441637 A & AU 8435688 A & DK 8405516 A & ZA 8409045 A & BR 8405908 A & HU 37403 T & DD 229123 A & ES 8603422 A & ES 8604727 A & ES 8605238 A & EP 142718 B & US 4719303 A & IL 73481 A & IL 85526 A & CA 1268463 A & JP 91-070695 B2 & DE 3441637 C2	1-6