

(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2015-504889

(P2015-504889A)

(43) 公表日 平成27年2月16日 (2015. 2. 16)

(51) Int.Cl.		F I			テーマコード (参考)
C O 7 D 498/04	(2006.01)	C O 7 D 498/04	1 O 5		4 C O 7 2
A O 1 N 43/90	(2006.01)	C O 7 D 498/04	C S P		4 H O 1 1
A O 1 P 13/00	(2006.01)	A O 1 N 43/90	1 O 3		
		A O 1 P 13/00			

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 73 頁)

(21) 出願番号	特願2014-551578 (P2014-551578)	(71) 出願人	508020155
(86) (22) 出願日	平成25年1月4日 (2013. 1. 4)		ビーエーエスエフ ソシエタス・ヨーロピア
(85) 翻訳文提出日	平成26年9月9日 (2014. 9. 9)		B A S F S E
(86) 国際出願番号	PCT/EP2013/050080		ドイツ連邦共和国 ルートヴィヒスハーフェン (番地なし)
(87) 国際公開番号	W02013/104561		D-67056 Ludwigshafen, Germany
(87) 国際公開日	平成25年7月18日 (2013. 7. 18)	(74) 代理人	100091096
(31) 優先権主張番号	61/585, 718		弁理士 平木 祐輔
(32) 優先日	平成24年1月12日 (2012. 1. 12)	(74) 代理人	100118773
(33) 優先権主張国	米国 (US)		弁理士 藤田 節
(31) 優先権主張番号	12150979.8	(74) 代理人	100122389
(32) 優先日	平成24年1月12日 (2012. 1. 12)		弁理士 新井 栄一
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)		

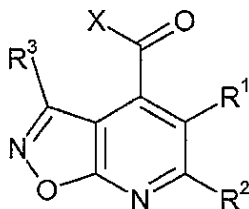
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 除草性イソオキサゾロ [5, 4-b] ピリジン

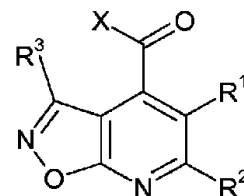
(57) 【要約】

本発明は、式(I)：

【化1】



(I)



(II)

で表されるイソオキサゾロ [5, 4-b] ピリジン化合物、式(I)のイソオキサゾロ [5, 4-b] ピリジン化合物の農業上有用な塩、およびそれらの除草剤としての使用に関する。

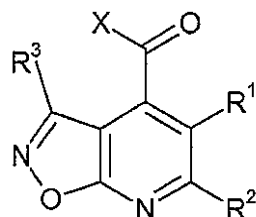
【選択図】 なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】



(I)

10

で表されるイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物または式 I のイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物の農業上有用な塩

(式 I において、可変要素は以下に定義されるとおりである：

R^1 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル、 C_2 - C_6 -アルケニル、 C_2 - C_6 -アルキニル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -ハロアルコキシ、フェニル、フェニル- C_1 - C_6 -アルキルであり；

R^2 は、水素、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -ヒドロキシアリル、 C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル、 C_1 - C_6 -アルキル- C_3 - C_6 -シクロアルキル、フェニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_2 - C_6 -アルケニル、 C_2 - C_6 -アルキニル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -ハロアルコキシ、 C_1 - C_6 -アルキルチオ、アミノ、 C_1 - C_6 -アルキルアミノ、 N,N -ジ-(C_1 - C_6 -アルキル)アミノ、ヘテロシクリル、フェニルであり；ここで R^2 のヘテロシクリル部分およびフェニル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、ニトロ、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -ハロアルコキシ、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニル、ヘテロシクリル、フェニルから選択される 1 つ以上の基で置換されていてもよく；

20

または R^1 および R^2 は共に C_3 - C_5 -アルカンジイルを形成し；

R^3 は、 C_3 - C_6 -シクロアルキルオキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルオキシ- C_1 - C_6 -アルキル、フェノキシ- C_1 - C_6 -アルキル、ヘテロシクリルオキシ- C_1 - C_6 -アルキル、フェニル- C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキル-カルボニルオキシ- C_1 - C_6 -アルキル、アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、(C_1 - C_6 -アルキル)アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、 N,N -ジ-(C_1 - C_6 -アルキル)アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、(C_3 - C_6 -シクロアルキル)アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、 N,N -ジ-(C_3 - C_6 -シクロアルキル)アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、[N -(C_1 - C_6 -アルキル), N -(C_3 - C_6 -シクロアルキル)]アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキル-カルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルコキシ- C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルキル、ホルミル、ホルミル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキル-カルボニル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_1 - C_6 -アルキル- C_3 - C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_1 - C_6 -ハロアルキル- C_3 - C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_1 - C_6 -ハロアルキル- C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_3 - C_6 -シクロアルキル- C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル- C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_3 - C_6 -シクロアルキル- C_1 - C_6 -ハロアルコキシ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル- C_1 - C_6 -ハロアルコキシ、 C_3 - C_6 -アルケニルオキシ、 C_3 - C_6 -ハロアルケニルオキシ、 C_3 - C_6 -アルキニルオキシ、 C_3 - C_6 -ハロアルキニルオキシ、 C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルコキシ、フェニル- C_1 - C_6 -アルコキシ、フェニル- C_1 - C_6 -ハロアルコキシ、ヘテロシクリル- C_1 - C_6 -アルコキシ、ヘテロシクリル- C_1 - C_6 -ハロアルコキシ、フェノキシ、ヘテロシクリルオキシ、フェニルカルボニルオキシ、ヘテロシクリルカルボニルオキシ、 C_3 - C_6 -シクロアルキルチオ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルチオ、 C_3 - C_6 -シクロアルキル- C_1 - C_6 -アルキルチオ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル- C_1 - C_6 -アルキルチオ、 C_3 - C_6 -シクロアルキル- C_1 - C_6 -ハロアルキルチオ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル- C_1 - C_6 -ハ

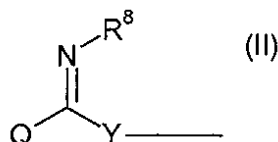
30

40

50

ロアルキルチオ、ヘテロシクリルチオ、フェニルチオ、フェニル- C_1-C_6 -アルキルチオ、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル、 C_3-C_6 -シクロアルキルスルホニル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキルスルホニル、ヘテロシクリルスルホニル、フェニルスルホニル、フェニル- C_1-C_6 -アルキルスルホニル、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_3-C_6 -シクロアルキルスルフィニル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキルスルフィニル、ヘテロシクリルスルフィニル、フェニルスルフィニル、フェニル- C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、フェニルアミノ、ヘテロシクリルアミノ、[N-(C_1-C_6 -アルキル),N-フェニル]アミノ、[N-(C_1-C_6 -アルキル),N-(C_3-C_6 -シクロアルキル)]アミノ、N-(C_3-C_6 -シクロアルキル)アミノ、N,N-ジ-(C_3-C_6 -シクロアルキル)アミノ、[N-(C_1-C_6 -アルキル),N-(C_3-C_6 -ハロシクロアルキル)]アミノ、[N-(C_1-C_6 -アルキル),N-(C_1-C_6 -ハロアルキル)]アミノ、(C_3-C_6 -ハロシクロアルキル)アミノ、N,N-ジ-(C_3-C_6 -ハロシクロアルキル)アミノ、[N-(C_1-C_6 -アルキル),N-(フェニル- C_1-C_6 -アルキル)]アミノ、(フェニル- C_1-C_6 -アルキル)アミノ、(ヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルキル)アミノ、N-[(C_3-C_6 -シクロアルキル)-(C_1-C_6 -アルキル)]アミノ、N,N-ジ-[(C_3-C_6 -シクロアルキル)-(C_1-C_6 -アルキル)]アミノ、N-[(C_3-C_6 -ハロシクロアルキル)-(C_1-C_6 -アルキル)]アミノ、N-(C_1-C_6 -アルキル)-N-[(C_3-C_6 -シクロアルキル)-(C_1-C_6 -アルキル)]アミノであり、ここで、 R^3 のヘテロシクリル部分およびフェニル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルコシカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、アミノ、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、N,N-ジ-(C_1-C_6 -アルキル)アミノ、ヘテロシクリル、フェニル、式II：

【化2】



(式中、

Qは、水素または C_1-C_6 -アルキルであり；

Yは、直接結合または C_1-C_6 -アルカンジイルであり；

R^8 は、アミノ、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノ、 C_1-C_6 -アルキル、ヒドロキシ、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]、または C_1-C_6 -ハロアルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]である)

で表される部分から選択される1つ以上の基で置換されていてもよく；

Xは、 OR^4 、 SR^5 ； NR^6R^7 であり；

R^4 、 R^5 は、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -ヒドロキシアルキル、 C_1-C_6 -シアノアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -ハロアルケニルオキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコシカルボニル- C_1-C_6 -アルキル、アミノカルボニル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキル-アミノカルボニル- C_1-C_6 -アルキル、N,N-ジ-(C_1-C_6 -アルキル)-アミノカルボニル- C_1-C_6 -アルキル、[N-(C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル),N-(C_1-C_6 -アルキル)]-アミノカルボニル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ-アミノカルボニル- C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル- C_2-C_6 -アルケニル、 C_3-C_6 -アルキニル、 C_3-C_6 -ハロアルキニル、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロシクリルカルボニル、フェニルカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル- C_1-C_6 -アルキル、フェニルカルボニル- C_1-C_6 -アルキル、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルキル、フェニル- C_1-C_6 -アルキルであり；こ

で R^4 および R^5 のフェニル部分およびヘテロシクリル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、ヘテロシクリル、フェニルから選択される1つ以上の基で置換されていてもよく；

R^6 、 R^7 は、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキルである）。

【請求項 2】

式Iにおいて、 R^1 が、水素、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキルである、請求項 1 に記載の式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物。

【請求項 3】

式Iにおいて、 R^1 が水素である、請求項 1 に記載の式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物。

10

【請求項 4】

式Iにおいて、 R^2 が、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -ヒドロキシアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニルである、請求項 1 ~ 3 のいずれか1項に記載の式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物。

【請求項 5】

式Iにおいて、 R^2 が、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキルである、請求項 1 ~ 4 のいずれか1項に記載の式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物。

20

【請求項 6】

式Iにおいて、

R^3 が、 C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキルオキシ- C_1-C_6 -アルキル、フェノキシ- C_1-C_6 -アルキル、ヘテロシクリルオキシ- C_1-C_6 -アルキル、フェニル- C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルオキシ- C_1-C_6 -アルキル、アミノ- C_1-C_6 -アルキル、(C_1-C_6 -アルキル)アミノ- C_1-C_6 -アルキル、N,N-ジ-(C_1-C_6 -アルキル)アミノ- C_1-C_6 -アルキル、(C_3-C_6 -シクロアルキル)アミノ- C_1-C_6 -アルキル、N,N-ジ-(C_3-C_6 -シクロアルキル)アミノ- C_1-C_6 -アルキル、[N-(C_1-C_6 -アルキル),N-(C_3-C_6 -シクロアルキル)]アミノ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキル-カルボニル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ- C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、ホルミル、ホルミル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキル-カルボニル、 C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 -ハロアルキル- C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 -ハロアルキル- C_3-C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル- C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_3-C_6 -アルケニルオキシ、 C_3-C_6 -ハロアルケニルオキシ、 C_3-C_6 -アルキニルオキシ、 C_3-C_6 -ハロアルキニルオキシ、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルコキシ、フェニル- C_1-C_6 -アルコキシ、フェニル- C_1-C_6 -ハロアルコキシ、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルコキシ、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -ハロアルコキシ、フェノキシ、ヘテロシクリルオキシ、フェニルカルボニルオキシ、ヘテロシクリルカルボニルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキルチオ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキルチオ、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル- C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、ヘテロシクリルチオ、フェニルチオ、フェニル- C_1-C_6 -アルキルチオ、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルキルチオ、フェニルアミノ、ヘテロシクリルアミノ、[N-(C_1-C_6 -アルキル),N-フェニル]アミノ、[N-(C_1-C_6 -アルキル),N-(C_3-C_6 -シクロアルキル)]アミノ、N-(C_3-C_6 -シクロアルキル)アミノ、N,N-ジ-(C_3-C_6 -シクロアルキル)アミノ、[N-(C_1-C_6 -アルキル),N-(C_3-C_6 -ハロシクロアルキル)]アミノ、[N-(C_1-C_6 -アルキル),N-(C_1-C_6 -ハロアルキル)]アミノ、(C_3-C_6 -ハロシクロアルキル)アミノ、N,N-ジ-(C_3-C_6 -ハロシクロアルキル)アミノ、[N-(C_1-C_6 -アルキル),N-(フェニル- C_1-C_6 -アルキル)]アミノ、(フェ

30

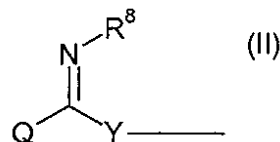
40

50

ニル-C₁-C₆-アルキル)アミノ、(ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル)アミノ、N-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N,N-ジ-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N-[(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N-(C₁-C₆-アルキル)-N-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノであり、ここでR³のヘテロシクリル部分およびフェニル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、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、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)アミノ、ヘテロシクリル、フェニル、式II：

10

【化3】



(式中、

Qは、水素またはC₁-C₆-アルキルであり；Yは、直接結合またはC₁-C₆-アルカンジイルであり；R⁸は、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、C₁-C₆-アルキル、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]、またはC₁-C₆-ハロアルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]である)

20

で表される部分から選択される1つ以上の基で置換されていてもよい、

請求項1～5のいずれか1項に記載の式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物。

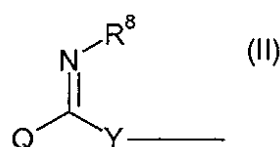
【請求項7】

式Iにおいて、

R³が、C₁-C₆-アルキル-カルボニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル-C₁-C₆-アルキル、ホルミル、ホルミル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルコキシ、C₃-C₆-アルケニルオキシ、C₃-C₆-アルキニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ、フェニル-C₁-C₆-アルコキシ、フェノキシ、ヘテロシクリルオキシ、フェニルカルボニルオキシ、C₃-C₆-シクロアルキルチオ、フェニルチオ、フェニル-C₁-C₆-アルキルチオ、フェニルアミノ、N-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ、N-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノであり、ここでR³のフェニル部分は、置換されていなくても、またはC₁-C₆-ハロアルキル、式II：

30

【化4】



40

(式中、

Qは、水素またはC₁-C₆-アルキルであり；Yは、直接結合またはC₁-C₆-アルカンジイルであり；R⁸は、アミノ、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]、またはC₁-C₆-ハロアルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]である)

で表される部分で置換されていてもよい、

請求項1～6のいずれか1項に記載の式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物。

【請求項8】

式Iにおいて、Xが、OR⁴、SR⁵である、請求項1～7のいずれか1項に記載の式Iのイソオ

50

キサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物。

【請求項 9】

式Iにおいて、

XがOR⁴であり；

R⁴が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₃-C₆-アルキニルである、

請求項 1 ~ 8 のいずれか1項に記載の式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物。

【請求項 10】

式Iにおいて、R⁴が水素である、請求項 1 ~ 9 のいずれか1項に記載の式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物。

10

【請求項 11】

式Iにおいて、

XがSR⁵であり；

R⁵が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、フェニル-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₃-C₆-アルキニルである、

請求項 1 ~ 8 のいずれか1項に記載の式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物。

【請求項 12】

除草活性量の請求項 1 ~ 11 のいずれか1項に記載される式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物またはIの農業上有用な塩の少なくとも1種と、作物保護剤の製剤化に慣用される助剤とを含む組成物。

20

【請求項 13】

除草活性量の請求項 1 ~ 11 のいずれか1項に記載される式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物またはIの農業上有用な塩の少なくとも1種と、作物保護剤の製剤化に慣用される助剤とを混合するステップを含む、請求項 12 に記載の組成物の調製方法。

【請求項 14】

除草有効量の請求項 1 ~ 11 のいずれか1項に記載される式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物もしくはIの農業上有用な塩の少なくとも1種、または請求項 12 に記載の組成物を、植物、それらの種子、および/またはそれらの生息地に作用させるステップを含む、望ましくない植生を防除する方法。

30

【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で表されるイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンおよびそれらの除草剤としての使用に関する。さらに本発明は、作物保護用の組成物および望ましくない植生を防除するための方法に関する。

【背景技術】

【0002】

イソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン部分を有する化合物は、当技術分野において公知である。US2009/163545は、このような化合物を、真核生物の寿命を変更するものとして記載している。WO2009/015208によれば、特定の尿素誘導体は抗菌作用を示す。イソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物の合成の経路の可能性は、Elbannanyら, Pharmazie (1988) 43(2), 128-129およびVolochnyukら, Journal of Combinatorial Chemistry (2010) 12(4), 510-517から公知である。

40

【0003】

WO2012/010633は、特定のイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物および除草剤としてのそれらの使用を開示する。US 5,510,319は、カルボン酸官能基を有する特定のイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物について記載する。

【0004】

農業においては、常に、活性、選択性および環境安全性に関して現在の処理方法を補完

50

しまたは上回る新規な活性成分を開発する必要性がある。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0005】

【特許文献1】US2009/163545

【特許文献2】WO2009/015208

【特許文献3】WO2012/010633

【特許文献4】US 5,510,319

【非特許文献】

【0006】

10

【非特許文献1】Elbannanyら, Pharmazie (1988) 43(2), 128-129

【非特許文献2】Volochnyukら, Journal of Combinatorial Chemistry (2010) 12(4), 510-517

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0007】

従って、本発明の目的は、除草剤として適した化合物を提供することである。特に、好ましくは低施用量において、望ましい植物(例えば作物)は無傷のままで高い除草活性を有する化合物を同定することが目的である。

【課題を解決するための手段】

20

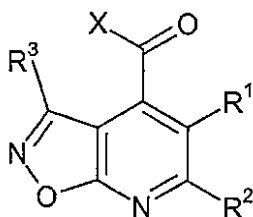
【0008】

これらの目的およびさらなる目的は、以下に定義される式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンおよびそれらの農業上有用な塩によって達成される。

【0009】

従って、本発明は、式I:

【化1】



30

【0010】

(ここで、式Iにおいて、可変要素は以下に定義されるとおりである:

R¹は、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、フェニル、フェニル-C₁-C₆-アルキルであり;

R²は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₆-シクロアルキル、フェニル-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)アミノ、ヘテロシクリル、フェニルであり;ここでR²のヘテロシクリル部分およびフェニル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、ニトロ、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-アルコキシカルボニル、ヘテロシクリル、フェニルから選択される1つ以上の基で置換されていてもよく;

40

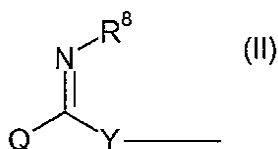
またはR¹およびR²は共にC₃-C₅-アルカンジイルを形成し;

R³は、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ-C₁-C₆-アルキル、フェノキシ-C₁-C₆-アルキル、ヘテロシクリルオキシ-C₁-C₆-アルキル、

50

フェニル-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-カルボニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、アミノ-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、N,N-ジ-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(C₃-C₆-シクロアルキル)]アミノ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ホルミル、ホルミル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、C₁-C₆-ハロアルキル-C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₁-C₆-ハロアルキル-C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルコキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキル-C₁-C₆-アルコキシ、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₆-アルケニルオキシ、C₃-C₆-ハロアルケニルオキシ、C₃-C₆-アルキニルオキシ、C₃-C₆-ハロアルキニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ、フェニル-C₁-C₆-アルコキシ、フェニル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルコキシ、ヘテロシクリル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、フェノキシ、ヘテロシクリルオキシ、フェニルカルボニルオキシ、ヘテロシクリルカルボニルオキシ、C₃-C₆-シクロアルキルチオ、C₃-C₆-ハロシクロアルキルチオ、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキルチオ、C₃-C₆-ハロシクロアルキル-C₁-C₆-アルキルチオ、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₃-C₆-ハロシクロアルキル-C₁-C₆-ハロアルキルチオ、ヘテロシクリルチオ、フェニルチオ、フェニル-C₁-C₆-アルキルチオ、ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニル、C₃-C₆-シクロアルキルスルホニル、C₃-C₆-ハロシクロアルキルスルホニル、ヘテロシクリルスルホニル、フェニルスルホニル、フェニル-C₁-C₆-アルキルスルホニル、ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₃-C₆-シクロアルキルスルフィニル、C₃-C₆-ハロシクロアルキルスルフィニル、ヘテロシクリルスルフィニル、フェニルスルフィニル、フェニル-C₁-C₆-アルキルスルフィニル、ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキルスルフィニル、フェニルアミノ、ヘテロシクリルアミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-フェニル]アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(C₃-C₆-シクロアルキル)]アミノ、N-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ、N,N-ジ-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)]アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(C₁-C₆-ハロアルキル)]アミノ、(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)アミノ、N,N-ジ-(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(フェニル-C₁-C₆-アルキル)]アミノ、(フェニル-C₁-C₆-アルキル)アミノ、(ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル)アミノ、N-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N,N-ジ-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N-[(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N-(C₁-C₆-アルキル)-N-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノであり、ここで、R³のヘテロシクリル部分およびフェニル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、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、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)アミノ、ヘテロシクリル、フェニル、式II：

【化2】



10

20

30

40

50

【 0 0 1 1 】

(式中、

Qは、水素またはC₁-C₆-アルキルであり；

Yは、直接結合またはC₁-C₆-アルカンジイルであり；

R⁸は、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、C₁-C₆-アルキル、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]、またはC₁-C₆-ハロアルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]である)

で表される部分から選択される1つ以上の基で置換されていてもよく；

Xは、OR⁴、SR⁵；NR⁶R⁷であり；

R⁴、R⁵は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-ハロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、[N-(C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル)，N-(C₁-C₆-アルキル)]-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-アルキニル-C₂-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₃-C₆-ハロアルキニル、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロシクリルカルボニル、フェニルカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、フェニルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル、フェニル-C₁-C₆-アルキルであり；ここでR⁴およびR⁵のフェニル部分およびヘテロシクリル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、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-アルコキシカルボニル、ヘテロシクリル、フェニルから選択される1つ以上の基で置換されていてもよく；

R⁶、R⁷は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキルである)

で表されるイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンおよびそれらの農業上有用な塩を提供する。

【 0 0 1 2 】

さらに、本発明の主題は、除草剤としての式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンの使用、すなわち、有害植物を防除するためのそれらの使用である。

【 0 0 1 3 】

また本発明は、少なくとも1種の式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンと、作物保護剤の製剤化に慣用される助剤とを含む組成物も提供する。

【 0 0 1 4 】

さらに本発明は、望ましくない植生を防除する方法であって、除草有効量の少なくとも1種の式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンを、植物、それらの種子、および/またはそれらの生息地に作用させる上記方法を提供する。施用は、望ましくない植物の出芽前、出芽中および/または出芽後、好ましくは出芽中および/または出芽後に行うことができる。

【 0 0 1 5 】

さらに、本発明は、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンの製造方法に関する。

【 0 0 1 6 】

本発明のさらなる実施形態は、請求項、明細書および実施例から明らかである。本発明の主題の、上記のおよび以下にさらに示される特徴は、各特定の場合に記載される組み合わせにおいてのみならず、本発明の範囲を離れることなく、他の組み合わせにおいても適用し得ることを理解されたい。

【 0 0 1 7 】

本明細書において使用される、用語「防除する」および「駆除する」は、同意語である。

【 0 0 1 8 】

本明細書において使用される、用語「望ましくない植生」、「雑草」および「有害植物

10

20

30

40

50

」は、同意語である。

【0019】

本明細書中に記載される式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンが、幾何異性体、例えばE/Z異性体を形成し得る場合、本発明による組成物中で、純粋な異性体およびそれらの混合物の両方を使用することができる。

【0020】

本明細書中に記載される式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンが1つ以上のキラル中心を有し、その結果、エナンチオマーまたはジアステレオマーとして存在する場合、本発明による組成物において、純粋なエナンチオマーおよびジアステレオマーならびにこれらの混合物の両方を使用することができる。

10

【0021】

可変要素の定義において有機基について使用される用語、例えば「アルキル」という表現は、これらの有機単位の群の個々の構成員を表す総称である。

【0022】

接頭辞 C_x-C_y は特定の場合における炭素原子の可能な数を示す。

【0023】

ハロゲン：フッ素、塩素、臭素またはヨウ素、特にフッ素、塩素または臭素である；

アルキルおよび複合基(例えば、アルコキシ、アルキルアミノ、アルキルチオ、アルコキシカルボニル)のアルキル部分：1~10個の炭素原子を有する飽和直鎖または分岐鎖炭化水素基(好ましくは C_1-C_6 -アルキルまたは C_1-C_4 -アルキル)、例えばメチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル、1,1-ジメチルエチル、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、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-メチルプロピルおよび1-エチル-2-メチルプロピル；ヘプチル、オクチル、2-エチルヘキシルおよびそれらの位置異性体；ノニル、デシルおよびそれらの位置異性体；

20

【0024】

ハロアルキル：1~10個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖アルキル基(上記)(好ましくは C_1-C_6 -ハロアルキルまたは C_1-C_4 -ハロアルキル)であって、これらの基中の水素原子の一部または全部が上記のハロゲン原子で置換されているもの。1つの実施形態において、上記のアルキル基は、特定のハロゲン原子(好ましくはフッ素、塩素または臭素)で少なくとも1回または完全に置換されている。さらなる実施形態において、上記のアルキル基は、異なるハロゲン原子で部分的にまたは完全にハロゲン化されており；混合ハロゲン置換の場合、塩素とフッ素の組み合わせが好ましい。特に好ましいのは、(C_1-C_3)-ハロアルキル、より好ましくは(C_1-C_2)-ハロアルキル、例えばクロロメチル、ブロモメチル、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、1-クロロエチル、1-ブロモエチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、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または1,1,1-トリフルオロプロパ-2-イルである；

30

40

【0025】

アルケニルおよびさらに複合基(例えば、アルケニルオキシ)内のアルケニル部分：2~10個の炭素原子を有し且つ任意の位置に1つの二重結合を有する不飽和直鎖または分岐鎖炭化水素基。本発明によれば、(C_2-C_6)-アルケニルなどの小さなアルケニル基を使用することが好ましい場合があり；他方、(C_5-C_8)-アルケニルなどの比較的大きなアルケニル基を用いることが好ましい場合もある。 C_2-C_6 -アルケニル基の例は：エテニル、1-プロペニル

50

、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-2-メチル-1-プロペニルおよび1-エチル-2-メチル-2-プロペニルである；

【0026】

アルキニルおよび複合基内のアルキニル部分：2～10個の炭素原子を有し、且つ任意の位置に1または2個の三重結合を有する直鎖または分岐鎖炭化水素基、例えば C_2 - C_6 -アルキニル、例えば、エチニル、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-ブチニルおよび1-エチル-1-メチル-2-プロピニル；

【0027】

シクロアルキルおよびさらに複合基内のシクロアルキル部分：3～10個、特に3～6個の炭素環員を有する単環式または二環式の飽和炭化水素基。 C_3 - C_6 -シクロアルキルの例は：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、シクロヘブチルまたはシクロオクチルである。二環式基の例は、ビスシクロ[2.2.1]ヘブチル、ビスシクロ[3.1.1]ヘブチル、ビスシクロ[2.2.2]オクチルおよびビスシクロ[3.2.1]オクチルを含む；

【0028】

シクロアルキルオキシ：酸素を介して結合された、上記に定義されるシクロアルキル基、例は：シクロプロピルオキシ、シクロブチルオキシ、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシ、シクロヘブチルオキシまたはシクロオクチルオキシである。

【0029】

ハロシクロアルキルおよび複合基内のハロシクロアルキル部分：3～10個の炭素環員を有する単環式飽和炭化水素基(上記)であって、その水素原子の一部または全部が上記のハロゲン原子(特にフッ素、塩素および臭素)で置換されていてよいもの；

【0030】

シクロアルケニル：3～10個、3～8個、3～6個、好ましくは5～6個の炭素環員を有する

10

20

30

40

50

単環式単不飽和炭化水素基、例えばシクロペンテン-1-イル、シクロペンテン-3-イル、シクロヘキセン-1-イル、シクロヘキセン-3-イル、シクロヘキセン-4-イルなど；

【0031】

アルコキシ：酸素を介して結合され、好ましくは1~10個、より好ましくは1~6個または1~4個の炭素原子を有する上記に定義されるアルキル基。例は：メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、1-メチルエトキシ、ブトキシ、1-メチルプロポキシ、2-メチルプロポキシまたは1,1-ジメチルエトキシ、およびさらに、例えば、ペントキシ、1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メチルブトキシ、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-ジメチルブトキシ、1,2-ジメチルブトキシ、1,3-ジメチルブトキシ、2,2-ジメチルブトキシ、2,3-ジメチルブトキシ、3,3-ジメチルブトキシ、1-エチルブトキシ、2-エチルブトキシ、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-メチルプロポキシまたは1-エチル-2-メチルプロポキシである；

10

20

30

【0032】

ハロアルコキシ：上記に定義されるアルコキシであって、これらの基中の水素原子の一部または全部が、ハロアルキルの項に記載される上記のハロゲン原子で(特にフッ素、塩素または臭素で)置換されているもの。例は、 OCH_2F 、 OCHF_2 、 OCF_3 、 OCH_2Cl 、 OCHCl_2 、 OCCl_3 、クロロフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブromoエトキシ、2-ヨードエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2-フルオロエトキシ、2-クロロ-2,2-ジフルオロエトキシ、2,2-ジクロロ-2-フルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ、 OC_2F_5 、2-フルオロプロポキシ、3-フルオロプロポキシ、2,2-ジフルオロプロポキシ、2,3-ジフルオロプロポキシ、2-クロロプロポキシ、3-クロロプロポキシ、2,3-ジクロロプロポキシ、2-ブromoプロポキシ、3-ブromoプロポキシ、3,3,3-トリフルオロプロポキシ、3,3,3-トリクロロプロポキシ、 $\text{OCH}_2\text{-C}_2\text{F}_5$ 、 $\text{OCF}_2\text{-C}_2\text{F}_5$ 、1-(CH_2F)-2-フルオロエトキシ、1-(CH_2Cl)-2-クロロエトキシ、1-(CH_2Br)-2-ブromoエトキシ、4-フルオロブトキシ、4-クロロブトキシ、4-ブromoブトキシまたはノナフルオロブトキシ；およびさらに、5-フルオロペントキシ、5-クロロペントキシ、5-ブromoペントキシ、5-ヨードペントキシ、ウンデカフルオロペントキシ、6-フルオロヘキソキシ、6-クロロヘキソキシ、6-ブromoヘキソキシ、6-ヨードヘキソキシまたはドデカフルオロヘキソキシである；

40

【0033】

アリール：6、7、8、9または10個の炭素原子を有する6~10員の芳香族炭素環。好ましいアリールの例は、フェニルまたはナフチルである；

【0034】

複素環：環員として、O、NおよびSから選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含み、また環員として、1つまたは2つのCO、SO、 SO_2 基をさらに含み得る5、6、7、8、9または10員の飽和、部分不飽和または芳香族の単環式環または二環式環系であって、当該複素環が、炭素原子を介して、または、存在する場合、窒素原子を介して結合されていてよいもの。特に：

40

- 環員として、O、NおよびSからなる群から選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含む3、5または6員の飽和または部分不飽和複素環：例えば、炭素環員に加えて、1、2または3個の窒素原子および/または1個の酸素原子もしくは硫黄原子または1もしくは2個の酸素原子および/または硫黄原子を含む、単環式飽和または部分不飽和複素環、例えば、アジリジン、オキシラン、2-テトラヒドロフラン、3-テトラヒドロフラン、2-テトラヒドロチエニル、3-テトラヒドロチエニル、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル、3-イソオキサゾリジニル、4-イソオキサゾリジニル、5-イソオキサゾリジニル、3-イソチアゾリジニル、4-イソチアゾリジニル、5-イソチアゾリジニル、3-ピラゾリジニル、4-ピラゾリジニル、5-ピラゾリジニル、2-オキサゾリジニル、4-オキサゾリジニル、5-オキサゾリジニル、2-チアゾリジニル、4-チアゾリジニル、5-チアゾリジニル、2-イミダゾリジニル、4-

50

イミダゾリジニル、1,2,4-オキサジアゾリジン-3-イル、1,2,4-オキサジアゾリジン-5-イル、1,2,4-チアジアゾリジン-3-イル、1,2,4-チアジアゾリジン-5-イル、1,2,4-トリアゾリジン-3-イル、1,3,4-オキサジアゾリジン-2-イル、1,3,4-チアジアゾリジン-2-イル、1,3,4-トリアゾリジン-2-イル、2,3-ジヒドロフラ-2-イル、2,3-ジヒドロフラ-3-イル、2,4-ジヒドロフラ-2-イル、2,4-ジヒドロフラ-3-イル、2,3-ジヒドロチエン-2-イル、2,3-ジヒドロチエン-3-イル、2,4-ジヒドロチエン-2-イル、2,4-ジヒドロチエン-3-イル、2-ピロリン-2-イル、2-ピロリン-3-イル、3-ピロリン-2-イル、3-ピロリン-3-イル、2-イソオキサゾリン-3-イル、3-イソオキサゾリン-3-イル、4-イソオキサゾリン-3-イル、2-イソオキサゾリン-4-イル、3-イソオキサゾリン-4-イル、4-イソオキサゾリン-4-イル、2-イソオキサゾリン-5-イル、3-イソオキサゾリン-5-イル、4-イソオキサゾリン-5-イル、2-イソチアゾリン-3-イル、3-イソチアゾリン-3-イル、4-イソチアゾリン-3-イル、2-イソチアゾリン-4-イル、3-イソチアゾリン-4-イル、4-イソチアゾリン-4-イル、2-イソチアゾリン-5-イル、3-イソチアゾリン-5-イル、4-イソチアゾリン-5-イル、2,3-ジヒドロピラゾール-1-イル、2,3-ジヒドロピラゾール-2-イル、2,3-ジヒドロピラゾール-3-イル、2,3-ジヒドロピラゾール-4-イル、2,3-ジヒドロピラゾール-5-イル、3,4-ジヒドロピラゾール-1-イル、3,4-ジヒドロピラゾール-3-イル、3,4-ジヒドロピラゾール-4-イル、3,4-ジヒドロピラゾール-5-イル、4,5-ジヒドロピラゾール-1-イル、4,5-ジヒドロピラゾール-3-イル、4,5-ジヒドロピラゾール-4-イル、4,5-ジヒドロピラゾール-5-イル、2,3-ジヒドロオキサゾール-2-イル、2,3-ジヒドロオキサゾール-3-イル、2,3-ジヒドロオキサゾール-4-イル、2,3-ジヒドロオキサゾール-5-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-2-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-3-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-4-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-5-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-2-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-3-イル、3,4-ジヒドロオキサゾール-4-イル、2-ピペリジニル、3-ピペリジニル、4-ピペリジニル、1,3-ジオキサン-5-イル、2-テトラヒドロピラニル、4-テトラヒドロピラニル、2-テトラヒドロチエニル、3-ヘキサヒドロピリダジニル、4-ヘキサヒドロピリダジニル、2-ヘキサヒドロピリミジニル、4-ヘキサヒドロピリミジニル、5-ヘキサヒドロピリミジニル、2-ピペラジニル、1,3,5-ヘキサヒドロトリアジン-2-イルおよび1,2,4-ヘキサヒドロトリアジン-3-イル、ならびにまた、対応する-イリデン基；

- 環員として、O、NおよびSからなる群から選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含む7員の飽和または部分不飽和複素環：例えば、炭素環員に加えて、1、2もしくは3個の窒素原子および/または1個の酸素原子もしくは硫黄原子、または1もしくは2個の酸素原子および/または硫黄原子を含む7員の環員を有する単環式および二環式複素環、例えばテトラ-およびヘキサヒドロアゼピニル、例えば、2,3,4,5-テトラヒドロ[1H]アゼピン-1-、-2-、-3-、-4-、-5-、-6-または-7-イル、3,4,5,6-テトラヒドロ[2H]アゼピン-2-、-3-、-4-、-5-、-6-または-7-イル、2,3,4,7-テトラヒドロ[1H]アゼピン-1-、-2-、-3-、-4-、-5-、-6-または-7-イル、2,3,6,7-テトラヒドロ[1H]アゼピン-1-、-2-、-3-、-4-、-5-、-6-または-7-イル、ヘキサヒドロアゼピン-1-、-2-、-3-または-4-イル、テトラ-およびヘキサヒドロオキセピニル、例えば、2,3,4,5-テトラヒドロ[1H]オキセピン-2-、-3-、-4-、-5-、-6-または-7-イル、2,3,4,7-テトラヒドロ[1H]オキセピン-2-、-3-、-4-、-5-、-6-または-7-イルなど)、ヘキサヒドロアゼピン-1-、-2-、-3-または-4-イル、テトラ-およびヘキサヒドロ-1,3-ジアゼピニル、テトラ-およびヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニル、テトラ-およびヘキサヒドロ-1,3-オキシアゼピニル、テトラ-およびヘキサヒドロ-1,4-オキシアゼピニル、テトラ-およびヘキサヒドロ-1,3-ジオキセピニル、テトラ-およびヘキサヒドロ-1,4-ジオキセピニルならびに対応するイリデン基；

- 酸素、窒素および硫黄からなる群から選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含む5または6員の芳香族複素環(=ヘテロ芳香族基)、例えば、炭素を介して結合され、環員として、1~3個の窒素原子または1もしくは2個の窒素原子および1個の硫黄原子もしくは酸素原子を含む5員ヘテロアリアル、例えば、2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、2-ピロリル、3-ピロリル、3-イソオキサゾリル、4-イソオキサゾリル、5-イソオキ

10

20

30

40

50

サゾリル、3-イソチアゾリル、4-イソチアゾリル、5-イソチアゾリル、3-ピラゾリル、4-ピラゾリル、5-ピラゾリル、2-オキサゾリル、4-オキサゾリル、5-オキサゾリル、2-チアゾリル、4-チアゾリル、5-チアゾリル、2-イミダゾリル、4-イミダゾリル、1,2,4-オキサジアゾール-3-イル、1,2,4-オキサジアゾール-5-イル、1,2,4-チアジアゾール-3-イル、1,2,4-チアジアゾール-5-イル、1,2,4-トリアゾール-3-イル、1,3,4-オキサジアゾール-2-イル、1,3,4-チアジアゾール-2-イルおよび1,3,4-トリアゾール-2-イル；窒素を介して結合され、環員として1~3個の窒素原子を含む5員ヘテロアリール、例えばピロール-1-イル、ピラゾール-1-イル、イミダゾール-1-イル、1,2,3-トリアゾール-1-イルおよび1,2,4-トリアゾール-1-イル；環員として、1、2または3個の窒素原子を含む6員ヘテロアリール、例えばピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、3-ピリダジニル、4-ピリダジニル、2-ピリミジニル、4-ピリミジニル、5-ピリミジニル、2-ピラジニル、1,3,5-トリアジン-2-イルおよび1,2,4-トリアジン-3-イル；

【0035】

式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンはまた、N-オキシドおよび/またはそれらの農業上有用な塩(この塩の性質は、一般的に重要ではない)の形態で存在していてもよい。一般的には、好適な塩は、そのカチオンまたはアニオンが、それぞれ式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンの除草活性に悪影響を及ぼさない、これらのカチオンの塩またはこれらの酸の酸付加塩である。

【0036】

好適なカチオンは特に、アルカリ金属(好ましくはリチウム、ナトリウムまたはカリウム)、アルカリ土類金属(好ましくはカルシウムまたはマグネシウム)、および遷移金属(好ましくはマンガン、銅、亜鉛または鉄)のイオンである。同様に、所望の場合には、カチオンとして、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、フェニルまたはベンジルで置換されていてよいアンモニウム、好ましくはアンモニウム、ジメチルアンモニウム、ジイソプロピルアンモニウム、テトラメチルアンモニウム、テトラブチルアンモニウム、2-(2-ヒドロキシエタ-1-オキシ)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、トリメチルベンジルアンモニウムを使用することもできる。好適な他のイオンは、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)スルホニウムまたはスルホオキシニウムイオン、好ましくはトリ(C₁-C₄-アルキル)スルホオキシニウムである。有用な酸付加塩のアニオンは、主に、塩化物イオン、臭化物イオン、フッ化物イオン、硫酸水素イオン、硫酸イオン、リン酸二水素イオン、リン酸水素イオン、硝酸イオン、炭酸水素イオン、炭酸イオン、ヘキサフルオロケイ酸イオン、ヘキサフルオロリン酸イオン、安息香酸イオン、ならびにC₁-C₄-アルカン酸のアニオン、好ましくはギ酸イオン、酢酸イオン、プロピオン酸イオン、酪酸イオンまたはトリフルオロ酢酸イオンである。

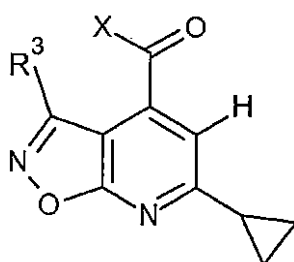
【0037】

一般的には、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンは、除草剤として適している。

【0038】

式I.a:

【化3】



I.a

【0039】

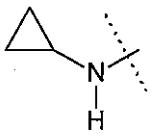
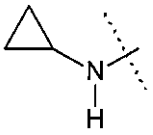
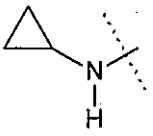
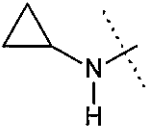
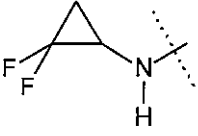
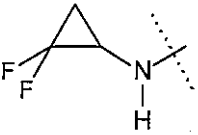
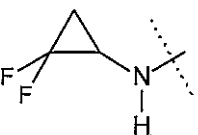
(式I.aは、 R^1 が水素であり、 R^2 がシクロプロピルである式Iに対応する)で表されるイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物またはそれらの農業上有用な塩は特に、除草剤として有用である。

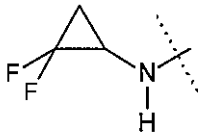
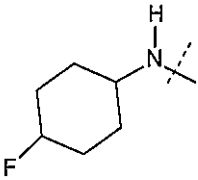
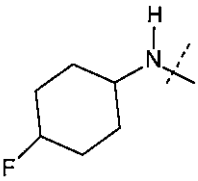
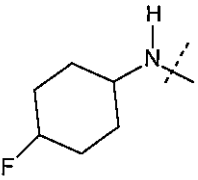
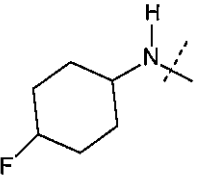
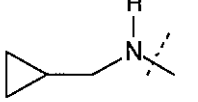
【 0 0 4 0 】

式I.aのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物の好ましい実施形態は、表1に記載される化合物1.a.1 ~ 1.a.40(表1の各行は、式Iの化合物の1つを表す)である。

【表 1】

表 1：イソオキサゾロ [5, 4-b] ピリジン化合物 1. a. 1～1. a. 40

No.	R ³	X
1.a.1.		-OH
1.a.2.		-OCH ₂ OCH ₃
1.a.3.		-NH ₂
1.a.4.		-SCH ₃
1.a.5.		-OH
1.a.6.		-OCH ₂ OCH ₃
1.a.7.		-NH ₂

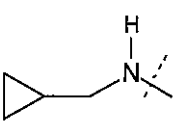
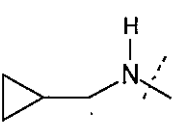
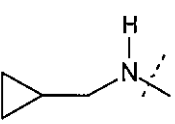
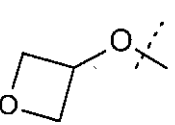
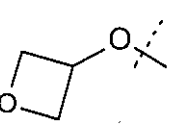
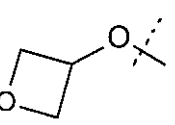
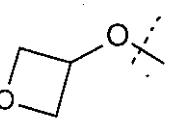
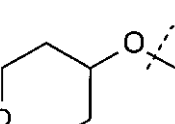
No.	R ³	X
1.a.8.		-SCH ₃
1.a.9.		-OH
1.a.10.		-OCH ₂ OCH ₃
1.a.11.		-NH ₂
1.a.12.		-SCH ₃
1.a.13.		-OH

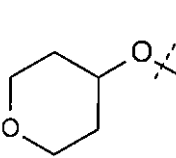
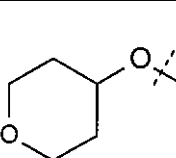
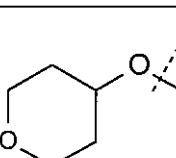
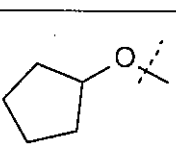
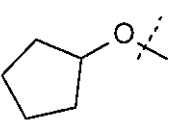
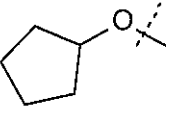
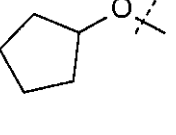
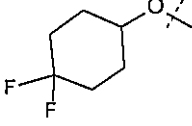
10

20

30

40

No.	R ³	X
I.a.14.		-OCH ₂ OCH ₃
I.a.15.		-NH ₂
I.a.16.		-SCH ₃
I.a.17.		-OH
I.a.18.		-OCH ₂ OCH ₃
I.a.19.		-NH ₂
I.a.20.		-SCH ₃
I.a.21.		-OH

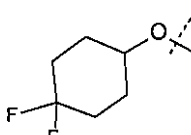
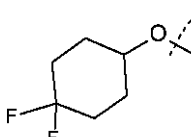
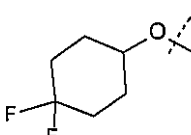
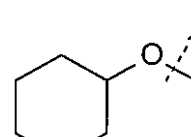
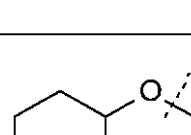
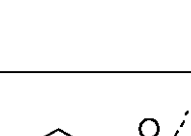
No.	R ³	X
I.a.22.		-OCH ₂ OCH ₃
I.a.23.		-NH ₂
I.a.24.		-SCH ₃
I.a.25.		-OH
I.a.26.		-OCH ₂ OCH ₃
I.a.27.		-NH ₂
I.a.28.		-SCH ₃
I.a.29.		-OH

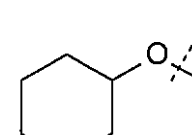
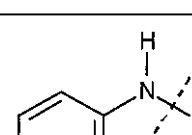
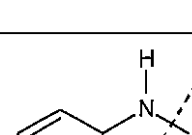
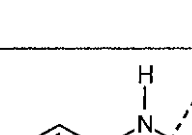
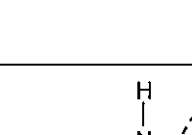
10

20

30

40

No.	R ³	X
I.a.30.		-OCH ₂ OCH ₃
I.a.31.		-NH ₂
I.a.32.		-SCH ₃
I.a.33.		-OH
I.a.34.		-OCH ₂ OCH ₃
I.a.35.		-NH ₂

No.	R ³	X
I.a.36.		-SCH ₃
I.a.37.		-OH
I.a.38.		-OCH ₂ OCH ₃
I.a.39.		-NH ₂
I.a.40.		-SCH ₃

10

20

30

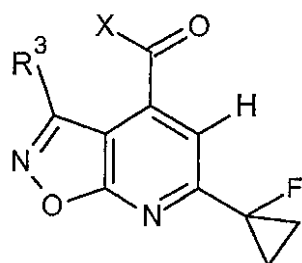
【 0 0 4 1 】

さらに、以下の式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物は、除草剤として特に有用である：

40

式I.b：

【化4】



I.b

50

【 0 0 4 2 】

(式I.bは、 R^1 が水素であり、 R^2 が1-フルオロシクロプロピルである式Iに対応する)で表されるイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物またはそれらの農業上有用な塩は特に、除草剤として有用である。

【 0 0 4 3 】

式I.bのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物の好ましい実施形態は、イソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物I.a.1~I.a.40とは、可変要素 R^2 が1-フルオロシクロプロピルである点についてのみ異なる化合物1.b.1~1.b.40である。

【 0 0 4 4 】

本発明の好ましい実施形態によれば、 R^1 が、水素、ハロゲン、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキルである、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物も好ましい。

10

【 0 0 4 5 】

特に好ましいのは、 R^1 が水素である、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物である。

【 0 0 4 6 】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、 R^2 が、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -ヒドロキシアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル、 C_2 - C_6 -アルケニル、 C_2 - C_6 -アルキニルである、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物も好ましい。

20

【 0 0 4 7 】

極めて特に好ましいのは、 R^2 が、 C_3 - C_6 -シクロアルキルまたは C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルである、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物である；最も特に好ましいのは、 R^2 が、シクロプロピルまたは1-フルオロシクロプロピルである、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物である。

【 0 0 4 8 】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、式中、

R^3 が、 C_3 - C_6 -シクロアルキルオキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルオキシ- C_1 - C_6 -アルキル、フェノキシ- C_1 - C_6 -アルキル、ヘテロシクリルオキシ- C_1 - C_6 -アルキル、フェニル- C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキル-カルボニルオキシ- C_1 - C_6 -アルキル、アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、(C_1 - C_6 -アルキル)アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、N,N-ジ-(C_1 - C_6 -アルキル)アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、(C_3 - C_6 -シクロアルキル)アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、N,N-ジ-(C_3 - C_6 -シクロアルキル)アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、[N-(C_1 - C_6 -アルキル),N-(C_3 - C_6 -シクロアルキル)]アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキル-カルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルコキシ- C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルキル、ホルミル、ホルミル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキル-カルボニル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_1 - C_6 -アルキル- C_3 - C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_1 - C_6 -アルキル- C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_1 - C_6 -ハロアルキル- C_3 - C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_1 - C_6 -ハロアルキル- C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_3 - C_6 -シクロアルキル- C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル- C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_3 - C_6 -シクロアルキル- C_1 - C_6 -ハロアルコキシ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル- C_1 - C_6 -ハロアルコキシ、 C_3 - C_6 -アルケニルオキシ、 C_3 - C_6 -ハロアルケニルオキシ、 C_3 - C_6 -アルキニルオキシ、 C_3 - C_6 -ハロアルキニルオキシ、 C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルコキシ、フェニル- C_1 - C_6 -アルコキシ、フェニル- C_1 - C_6 -ハロアルコキシ、ヘテロシクリル- C_1 - C_6 -アルコキシ、ヘテロシクリル- C_1 - C_6 -ハロアルコキシ、フェノキシ、ヘテロシクリルオキシ、フェニルカルボニルオキシ、ヘテロシクリルカルボニルオキシ、 C_3 - C_6 -シクロアルキルチオ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルチオ、 C_3 - C_6 -シクロアルキル- C_1 - C_6 -アルキルチオ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル- C_1 - C_6 -アルキルチオ、 C_3 - C_6 -シクロアルキル- C_1 - C_6 -ハロアルキルチオ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル- C_1 - C_6 -ハロアルキルチオ、ヘテロシクリルチオ、フェニルチオ、フェニル- C_1 - C_6 -アルキルチオ、ヘテロシクリル- C_1 - C_6 -アルキルチオ、フェニルアミノ、ヘテロシクリルアミノ、[N-(C_1 -

30

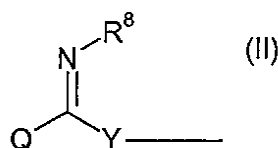
40

50

C₆-アルキル), N-フェニル]アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル), N-(C₃-C₆-シクロアルキル)]アミノ、N-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ、N,N-ジ-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル), N-(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)]アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル), N-(C₁-C₆-ハロアルキル)]アミノ、(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)アミノ、N,N-ジ-(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル), N-(フェニル-C₁-C₆-アルキル)]アミノ、(フェニル-C₁-C₆-アルキル)アミノ、(ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル)アミノ、N-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N,N-ジ-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N-[(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N-(C₁-C₆-アルキル)-N-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノであり、ここで、R³のヘテロシクリル部分およびフェニル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、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、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)アミノ、ヘテロシクリル、フェニル、式II:

10

【化5】



20

【0049】

(式中、

Qは、水素またはC₁-C₆-アルキルであり；Yは、直接結合またはC₁-C₆-アルカンジイルであり；R⁸は、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、C₁-C₆-アルキル、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]、またはC₁-C₆-ハロアルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]である)

で表される部分から選択される1つ以上の基で置換されていてもよい、

式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物も好ましい。

30

【0050】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、式中、

R³が、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ-C₁-C₆-アルキル、フェノキシ-C₁-C₆-アルキル、ヘテロシクリルオキシ-C₁-C₆-アルキル、フェニル-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-カルボニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、アミノ-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、N,N-ジ-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、[N-(C₁-C₆-アルキル), N-(C₃-C₆-シクロアルキル)]アミノ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ホルミル、ホルミル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、C₁-C₆-ハロアルキル-C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₁-C₆-ハロアルキル-C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルコキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキル-C₁-C₆-アルコキシ、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₆-アルケニルオキシ、C₃-C₆-ハロアルケニルオキシ、C₃-C₆-アルキニルオキシ、C₃-C₆-ハロアルキニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ、フェニル-C₁-C₆-アルコキシ、フェニル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルコキシ、ヘテロシクリル-C₁-C₆-ハロアル

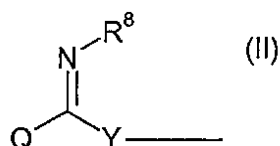
40

50

コキシ、フェノキシ、ヘテロシクリルオキシ、フェニルカルボニルオキシ、ヘテロシクリルカルボニルオキシ、フェニルアミノ、ヘテロシクリルアミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-フェニル]アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(C₃-C₆-シクロアルキル)]アミノ、N-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ、N,N-ジ-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)]アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(C₁-C₆-ハロアルキル)]アミノ、(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)アミノ、N,N-ジ-(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(フェニル-C₁-C₆-アルキル)]アミノ、(フェニル-C₁-C₆-アルキル)アミノ、(ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル)アミノ、N-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N,N-ジ-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N-[(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N-(C₁-C₆-アルキル)-N-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノであり、ここで、R³のヘテロシクリル部分およびフェニル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、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、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)アミノ、ヘテロシクリル、フェニル、式II：

10

【化6】



20

【0051】

(式中、

Qは、水素またはC₁-C₆-アルキルであり；Yは、直接結合またはC₁-C₆-アルカンジイルであり；R⁸は、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、C₁-C₆-アルキル、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]、またはC₁-C₆-ハロアルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]である)

30

で表される部分から選択される1つ以上の基で置換されていてもよい、

式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物も好ましい。

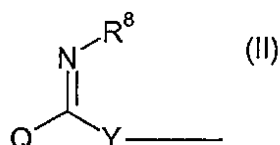
【0052】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、

R³が、C₁-C₆-アルキル-カルボニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル-C₁-C₆-アルキル、ホルミル、ホルミル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルコキシ、C₃-C₆-アルケニルオキシ、C₃-C₆-アルキニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ、フェニル-C₁-C₆-アルコキシ、フェノキシ、ヘテロシクリルオキシ、フェニルカルボニルオキシ、C₃-C₆-シクロアルキルチオ、フェニルチオ、フェニル-C₁-C₆-アルキルチオ、フェニルアミノ、N-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ、N-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノであり、ここで、R³のフェニル部分は、置換されていなくても、または、C₁-C₆-ハロアルキル、式II：

40

【化7】



【0053】

50

(式中、

Qは、水素またはC₁-C₆-アルキルであり；

Yは、直接結合またはC₁-C₆-アルカンジイルであり；

R⁸は、アミノ、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]、またはC₁-C₆-ハロアルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]である)

で表される部分で置換されていてもよい、

式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物も好ましい。

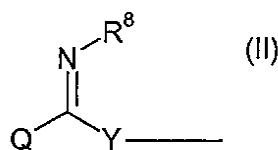
【0054】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、式中、

R³が、C₁-C₆-アルキル-カルボニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル-C₁-C₆-アルキル、ホルミル、ホルミル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルコキシ、C₃-C₆-アルケニルオキシ、C₃-C₆-アルキニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ、フェニル-C₁-C₆-アルコキシ、フェノキシ、ヘテロシクリルオキシ、フェニルカルボニルオキシ、フェニルアミノ、N-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ、N-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、式II：

10

【化8】



20

【0055】

(式中、

Qは、水素またはC₁-C₆-アルキルであり；

Yは、直接結合またはC₁-C₆-アルカンジイルであり；

R⁸は、アミノ、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]、またはC₁-C₆-ハロアルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]である)

で表される部分である、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物も好ましい。

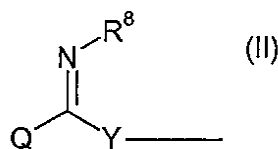
30

【0056】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、式中、

R³が、C₁-C₆-アルキル-カルボニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル-C₁-C₆-アルキル、ホルミル、ホルミル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₃-C₆-アルケニルオキシ、C₃-C₆-アルキニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ、フェニル-C₁-C₆-アルコキシ、フェノキシ、フェニルカルボニルオキシ、フェニルアミノ、N-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ、N-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、式II：

【化9】



40

【0057】

(式中、

Qは、水素またはC₁-C₆-アルキルであり；

Yは、直接結合またはC₁-C₆-アルカンジイルであり；

R⁸は、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]、またはC₁-C₆-ハロアルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]である)

で表される部分である、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物も好ましい。

50

【 0 0 5 8 】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、

R^3 が、 C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 -ハロアルキル- C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 -ハロアルキル- C_3-C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル- C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_3-C_6 -アルケニルオキシ、 C_3-C_6 -ハロアルケニルオキシ、 C_3-C_6 -アルキニルオキシ、 C_3-C_6 -ハロアルキニルオキシ、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルコキシ、フェニル- C_1-C_6 -アルコキシ、フェニル- C_1-C_6 -ハロアルコキシ、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルコキシ、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -ハロアルコキシ、フェノキシ、ヘテロシクリルオキシである、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物も好ましい。

10

【 0 0 5 9 】

特に好ましいのは、 R^3 が、 C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、フェニルアミノまたはN-(C_3-C_6 -シクロアルキル)アミノである、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物である。

【 0 0 6 0 】

極めて特に好ましいのは、 R^3 が、 C_3-C_6 -シクロアルキルオキシまたは C_3-C_6 -ハロシクロアルキルオキシである、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物である。

【 0 0 6 1 】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、Xが OR^4 である、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物も好ましい。

20

【 0 0 6 2 】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、 R^4 が、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -シアノアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_3-C_6 -アルキニルである、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物も好ましい。

【 0 0 6 3 】

特に好ましいのは、 R^4 が、水素、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル、tert.-ブチルである、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物である。最も特に好ましいのは、 R^4 が水素である、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物である。

30

【 0 0 6 4 】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、Xが SR^5 である、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物も好ましい。

【 0 0 6 5 】

本発明の別の好ましい実施形態によれば、 R^5 が、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、フェニル- C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_3-C_6 -アルキニルである、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物も好ましい。

【 0 0 6 6 】

特に好ましいのは、 R^5 が、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、フェニル- C_1-C_6 -アルキルである、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物である。最も特に好ましいのは、 R^5 が、 C_1-C_6 -アルキルまたはフェニル- C_1-C_6 -アルキルである、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物である。

40

【 0 0 6 7 】

除草剤として特に有用なのは、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物であって、式中、

R^1 が水素であり；

R^2 が、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -ヒドロキシアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニルであり；

50

R^3 が、 C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキルオキシ- C_1-C_6 -アルキル、フェノキシ- C_1-C_6 -アルキル、ヘテロシクリルオキシ- C_1-C_6 -アルキル、フェニル- C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキル-カルボニルオキシ- C_1-C_6 -アルキル、アミノ- C_1-C_6 -アルキル、(C_1-C_6 -アルキル)アミノ- C_1-C_6 -アルキル、 N,N -ジ-(C_1-C_6 -アルキル)アミノ- C_1-C_6 -アルキル、(C_3-C_6 -シクロアルキル)アミノ- C_1-C_6 -アルキル、 N,N -ジ-(C_3-C_6 -シクロアルキル)アミノ- C_1-C_6 -アルキル、[N -(C_1-C_6 -アルキル), N -(C_3-C_6 -シクロアルキル)]アミノ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキル-カルボニル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ- C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、ホルミル、ホルミル- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキル-カルボニル、 C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 -ハロアルキル- C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 -ハロアルキル- C_3-C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル- C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_3-C_6 -アルケニルオキシ、 C_3-C_6 -ハロアルケニルオキシ、 C_3-C_6 -アルキニルオキシ、 C_3-C_6 -ハロアルキニルオキシ、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルコキシ、フェニル- C_1-C_6 -アルコキシ、フェニル- C_1-C_6 -ハロアルコキシ、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルコキシ、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -ハロアルコキシ、フェノキシ、ヘテロシクリルオキシ、フェニルカルボニルオキシ、ヘテロシクリルカルボニルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキルチオ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキルチオ、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル- C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、ヘテロシクリルチオ、フェニルチオ、フェニル- C_1-C_6 -アルキルチオ、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル、 C_3-C_6 -シクロアルキルスルホニル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキルスルホニル、ヘテロシクリルスルホニル、フェニルスルホニル、フェニル- C_1-C_6 -アルキルスルホニル、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_3-C_6 -シクロアルキルスルフィニル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキルスルフィニル、ヘテロシクリルスルフィニル、フェニルスルフィニル、フェニル- C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、フェニルアミノ、ヘテロシクリルアミノ、[N -(C_1-C_6 -アルキル), N -フェニル]アミノ、[N -(C_1-C_6 -アルキル), N -(C_3-C_6 -シクロアルキル)]アミノ、 N -(C_3-C_6 -シクロアルキル)アミノ、 N,N -ジ-(C_3-C_6 -シクロアルキル)アミノ、[N -(C_1-C_6 -アルキル), N -(C_3-C_6 -ハロシクロアルキル)]アミノ、[N -(C_1-C_6 -アルキル), N -(C_1-C_6 -ハロアルキル)]アミノ、(C_3-C_6 -ハロシクロアルキル)アミノ、 N,N -ジ-(C_3-C_6 -ハロシクロアルキル)アミノ、[N -(C_1-C_6 -アルキル), N -(フェニル- C_1-C_6 -アルキル)]アミノ、(フェニル- C_1-C_6 -アルキル)アミノ、(ヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルキル)アミノ、 N -[(C_3-C_6 -シクロアルキル)-(C_1-C_6 -アルキル)]アミノ、 N,N -ジ-[(C_3-C_6 -シクロアルキル)-(C_1-C_6 -アルキル)]アミノ、 N -[(C_3-C_6 -ハロシクロアルキル)-(C_1-C_6 -アルキル)]アミノ、 N -(C_1-C_6 -アルキル)- N -[(C_3-C_6 -シクロアルキル)-(C_1-C_6 -アルキル)]アミノであり、ここで、 R^3 のヘテロシクリル部分およびフェニル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、アミノ、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、 N,N -ジ-(C_1-C_6 -アルキル)アミノ、ヘテロシクリル、フェニル、式II：

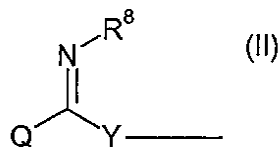
10

20

30

40

【化 10】



【0068】

(式中、

Qは、水素またはC₁-C₆-アルキルであり；

Yは、直接結合またはC₁-C₆-アルカンジイルであり；

R⁸は、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、C₁-C₆-アルキル、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]、またはC₁-C₆-ハロアルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]である)

で表される部分から選択される1つ以上の基で置換されていてもよく；

XがOR⁴であり；

R⁴が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-ハロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、[N-(C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル),N-(C₁-C₆-アルキル)]-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-アルキニル-C₂-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₃-C₆-ハロアルキニル、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロシクリルカルボニル、フェニルカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、フェニルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル、フェニル-C₁-C₆-アルキルであり；ここでR⁴およびR⁵のフェニル部分およびヘテロシクリル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、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-アルコキシカルボニル、ヘテロシクリル、フェニルから選択される1つ以上の基で置換されていてもよい、

上記化合物およびそれらの農業上有用な塩である。

【0069】

除草剤として特に有用なのは、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物であって、式中、

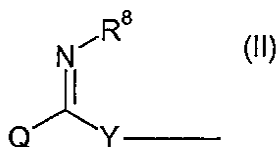
R¹が水素であり；

R²が、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニルであり；

R³が、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ-C₁-C₆-アルキル、フェノキシ-C₁-C₆-アルキル、ヘテロシクリルオキシ-C₁-C₆-アルキル、フェニル-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-カルボニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、アミノ-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、N,N-ジ-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(C₃-C₆-シクロアルキル)]アミノ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ホルミル、ホルミル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、C₁-C₆-ハロアルキル-C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₁-C₆

-ハロアルキル-C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルコキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキル-C₁-C₆-アルコキシ、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₆-アルケニルオキシ、C₃-C₆-ハロアルケニルオキシ、C₃-C₆-アルキニルオキシ、C₃-C₆-ハロアルキニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ、フェニル-C₁-C₆-アルコキシ、フェニル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルコキシ、ヘテロシクリル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、フェノキシ、ヘテロシクリルオキシ、フェニルカルボニルオキシ、ヘテロシクリルカルボニルオキシ、フェニルアミノ、ヘテロシクリルアミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル), N-フェニル]アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル), N-(C₃-C₆-シクロアルキル)]アミノ、N-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ、N,N-ジ-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル), N-(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)]アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル), N-(C₁-C₆-ハロアルキル)]アミノ、(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)アミノ、N,N-ジ-(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル), N-(フェニル-C₁-C₆-アルキル)]アミノ、(フェニル-C₁-C₆-アルキル)アミノ、(ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル)アミノ、N-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N,N-ジ-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N-[(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N-(C₁-C₆-アルキル)-N-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノであり、ここで、R³のヘテロシクリル部分およびフェニル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、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、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)アミノ、ヘテロシクリル、フェニル、式II:

【化11】



【0070】

(式中、

Qは、水素またはC₁-C₆-アルキルであり；

Yは、直接結合またはC₁-C₆-アルカンジイルであり；

R⁸は、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、C₁-C₆-アルキル、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]、またはC₁-C₆-ハロアルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]である)

で表される部分から選択される1つ以上の基で置換されていてもよく；

XがOR⁴であり；

R⁴が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-ハロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、[N-(C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル), N-(C₁-C₆-アルキル)]-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-アルキニル-C₂-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₃-C₆-ハロアルキニル、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロシクリルカルボニル、フェニルカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、フェニルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル、フェニル-C₁-C₆-アルキルであり；ここでR⁴

およびR⁵のフェニル部分およびヘテロシクリル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、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-アルコキシカルボニル、ヘテロシクリル、フェニルから選択される1つ以上の基で置換されていてもよい、

上記化合物およびそれらの農業上有用な塩である。

【0071】

除草剤として特に有用なのは、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物であって、式中、

R¹が水素であり；

R²が、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニルであり；

R³が、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、C₁-C₆-ハロアルキル-C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₁-C₆-ハロアルキル-C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルコキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキル-C₁-C₆-アルコキシ、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₆-アルケニルオキシ、C₃-C₆-ハロアルケニルオキシ、C₃-C₆-アルキニルオキシ、C₃-C₆-ハロアルキニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ、フェニル-C₁-C₆-アルコキシ、フェニル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルコキシ、ヘテロシクリル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、フェノキシ、ヘテロシクリルオキシであり；

XがOR⁴であり；

R⁴が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-ハロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、[N-(C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル),N-(C₁-C₆-アルキル)]-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-アルキニル-C₂-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₃-C₆-ハロアルキニル、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロシクリルカルボニル、フェニルカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、フェニルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル、フェニル-C₁-C₆-アルキルであり；ここでR⁴およびR⁵のフェニル部分およびヘテロシクリル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、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-アルコキシカルボニル、ヘテロシクリル、フェニルから選択される1つ以上の基で置換されていてもよい、

上記化合物およびそれらの農業上有用な塩である。

【0072】

除草剤として特に有用なのは、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物であって、式中、

R¹が水素であり；

R²が、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニルであり；

R³が、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシであり；

XがOR⁴であり；

R⁴が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニルオキシ-C

$_1$ - C_6 -アルキル、 C_2 - C_6 -ハロアルケニルオキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、アミノカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキル-アミノカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 N,N -ジ-(C_1 - C_6 -アルキル)-アミノカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 $[N-(C_3$ - C_6 -シクロアルキル- C_1 - C_6 -アルキル), $N-(C_1$ - C_6 -アルキル)]-アミノカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ-アミノカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_2 - C_6 -アルケニル、 C_2 - C_6 -ハロアルケニル、 C_2 - C_6 -アルキニル- C_2 - C_6 -アルケニル、 C_3 - C_6 -アルキニル、 C_3 - C_6 -ハロアルキニル、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロシクリルカルボニル、フェニルカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、フェニルカルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、ヘテロシクリル- C_1 - C_6 -アルキル、フェニル- C_1 - C_6 -アルキルであり；ここで R^4 および R^5 のフェニル部分およびヘテロシクリル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -ハロアルコキシ、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニル、ヘテロシクリル、フェニルから選択される1つ以上の基で置換されていてもよい、

10

上記化合物およびそれらの農業上有用な塩である。

【0073】

除草剤として特に有用なのは、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物であって、式中、

R^1 が水素であり；

R^2 が、水素、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -ヒドロキシアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル、 C_2 - C_6 -アルケニル、 C_2 - C_6 -アルキニルであり；

20

R^3 が、 C_3 - C_6 -シクロアルキルオキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルオキシ- C_1 - C_6 -アルキル、フェノキシ- C_1 - C_6 -アルキル、ヘテロシクリルオキシ- C_1 - C_6 -アルキル、フェニル- C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキル-カルボニルオキシ- C_1 - C_6 -アルキル、アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、(C_1 - C_6 -アルキル)アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、 N,N -ジ-(C_1 - C_6 -アルキル)アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、(C_3 - C_6 -シクロアルキル)アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、 N,N -ジ-(C_3 - C_6 -シクロアルキル)アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、 $[N-(C_1$ - C_6 -アルキル), $N-(C_3$ - C_6 -シクロアルキル)]アミノ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキル-カルボニル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルコキシ- C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルキル、ホルミル、ホルミル- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキル-カルボニル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_1 - C_6 -アルキル- C_3 - C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_1 - C_6 -ハロアルキル- C_3 - C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_1 - C_6 -ハロアルキル- C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_3 - C_6 -シクロアルキル- C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル- C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_3 - C_6 -シクロアルキル- C_1 - C_6 -ハロアルコキシ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル- C_1 - C_6 -ハロアルコキシ、 C_3 - C_6 -アルケニルオキシ、 C_3 - C_6 -ハロアルケニルオキシ、 C_3 - C_6 -アルキニルオキシ、 C_3 - C_6 -ハロアルキニルオキシ、 C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルコキシ、フェニル- C_1 - C_6 -アルコキシ、フェニル- C_1 - C_6 -ハロアルコキシ、ヘテロシクリル- C_1 - C_6 -アルコキシ、ヘテロシクリル- C_1 - C_6 -ハロアルコキシ、フェノキシ、ヘテロシクリルオキシ、フェニルカルボニルオキシ、ヘテロシクリルカルボニルオキシ、 C_3 - C_6 -シクロアルキルチオ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルチオ、 C_3 - C_6 -シクロアルキル- C_1 - C_6 -アルキルチオ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル- C_1 - C_6 -アルキルチオ、 C_3 - C_6 -シクロアルキル- C_1 - C_6 -ハロアルキルチオ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル- C_1 - C_6 -ハロアルキルチオ、ヘテロシクリルチオ、フェニルチオ、フェニル- C_1 - C_6 -アルキルチオ、ヘテロシクリル- C_1 - C_6 -アルキルチオ、 C_1 - C_6 -アルキルスルホニル、 C_1 - C_6 -ハロアルキルスルホニル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルスルホニル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルスルホニル、ヘテロシクリルスルホニル、フェニルスルホニル、フェニル- C_1 - C_6 -アルキルスルホニル、ヘテロシクリル- C_1 - C_6 -アルキルスルホニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1 - C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルスルフィニル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルスルフィニル、ヘテロシクリルスルフィニル、フェニルスルフィニル、フェニル- C_1 - C_6

30

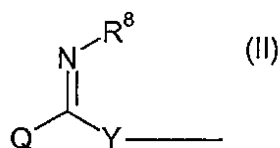
40

50

-アルキルスルフィニル、ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキルスルフィニル、フェニルアミノ、ヘテロシクリルアミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-フェニル]アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(C₃-C₆-シクロアルキル)]アミノ、N-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ、N,N-ジ-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)]アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(C₁-C₆-ハロアルキル)]アミノ、(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)アミノ、N,N-ジ-(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(フェニル-C₁-C₆-アルキル)]アミノ、(フェニル-C₁-C₆-アルキル)アミノ、(ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル)アミノ、N-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N,N-ジ-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N-[(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N-(C₁-C₆-アルキル)-N-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノであり、ここで、R³のヘテロシクリル部分およびフェニル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルコシカルボニル、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、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)アミノ、ヘテロシクリル、フェニル、式II：

10

【化12】



20

【0074】

(式中、

Qは、水素またはC₁-C₆-アルキルであり；Yは、直接結合またはC₁-C₆-アルカンジイルであり；R⁸は、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、C₁-C₆-アルキル、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]、またはC₁-C₆-ハロアルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]である)

30

で表される部分から選択される1つ以上の基で置換されていてもよく；

XがSR⁵であり；R⁵が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、フェニル-C₁-C₆-アルキルであり；最も好ましくはC₁-C₆-アルキル、フェニル-C₁-C₆-アルキルである、

上記化合物およびそれらの農業上有用な塩である。

【0075】

除草剤としてさらに特に有用なのは、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物であって、式中、

R¹が水素であり；R²が、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキルであり；最も好ましくはシクロプロピルまたは1-フルオロシクロプロピルであり；

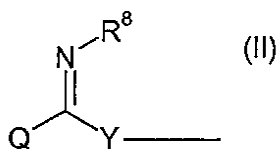
40

R³が、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ-C₁-C₆-アルキル、フェノキシ-C₁-C₆-アルキル、ヘテロシクリルオキシ-C₁-C₆-アルキル、フェニル-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-カルボニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、アミノ-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、N,N-ジ-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(C₃-C₆-シクロアルキル)]アミノ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ホルミル、ホルミル-C₁-C₆-

50

アルキル、 C_1-C_6 -アルキル-カルボニル、 C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 -ハロアルキル- C_3-C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_1-C_6 -ハロアルキル- C_3-C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル- C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_3-C_6 -アルケニルオキシ、 C_3-C_6 -ハロアルケニルオキシ、 C_3-C_6 -アルキニルオキシ、 C_3-C_6 -ハロアルキニルオキシ、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルコキシ、フェニル- C_1-C_6 -アルコキシ、フェニル- C_1-C_6 -ハロアルコキシ、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルコキシ、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -ハロアルコキシ、フェノキシ、ヘテロシクリルオキシ、フェニルカルボニルオキシ、ヘテロシクリルカルボニルオキシ、 C_3-C_6 -シクロアルキルチオ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキルチオ、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_3-C_6 -シクロアルキル- C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル- C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、ヘテロシクリルチオ、フェニルチオ、フェニル- C_1-C_6 -アルキルチオ、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル、 C_3-C_6 -シクロアルキルスルホニル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキルスルホニル、ヘテロシクリルスルホニル、フェニルスルホニル、フェニル- C_1-C_6 -アルキルスルホニル、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_3-C_6 -シクロアルキルスルフィニル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキルスルフィニル、ヘテロシクリルスルフィニル、フェニルスルフィニル、フェニル- C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、ヘテロシクリル- C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、フェニルアミノ、ヘテロシクリルアミノ、 $[N-(C_1-C_6\text{-アルキル}), N\text{-フェニル}]$ アミノ、 $[N-(C_1-C_6\text{-アルキル}), N-(C_3-C_6\text{-シクロアルキル})]$ アミノ、 $N-(C_3-C_6\text{-シクロアルキル})$ アミノ、 N,N -ジ- $(C_3-C_6\text{-シクロアルキル})$ アミノ、 $[N-(C_1-C_6\text{-アルキル}), N-(C_3-C_6\text{-ハロシクロアルキル})]$ アミノ、 $[N-(C_1-C_6\text{-アルキル}), N-(C_1-C_6\text{-ハロアルキル})]$ アミノ、 $(C_3-C_6\text{-ハロシクロアルキル})$ アミノ、 N,N -ジ- $(C_3-C_6\text{-ハロシクロアルキル})$ アミノ、 $[N-(C_1-C_6\text{-アルキル}), N-(フェニル-C_1-C_6\text{-アルキル})]$ アミノ、 $(フェニル-C_1-C_6\text{-アルキル})$ アミノ、 $(ヘテロシクリル-C_1-C_6\text{-アルキル})$ アミノ、 $N-[(C_3-C_6\text{-シクロアルキル})-(C_1-C_6\text{-アルキル})]$ アミノ、 N,N -ジ- $[(C_3-C_6\text{-シクロアルキル})-(C_1-C_6\text{-アルキル})]$ アミノ、 $N-[(C_3-C_6\text{-ハロシクロアルキル})-(C_1-C_6\text{-アルキル})]$ アミノ、 $N-(C_1-C_6\text{-アルキル})-N-[(C_3-C_6\text{-シクロアルキル})-(C_1-C_6\text{-アルキル})]$ アミノであり、ここで、 R^3 のヘテロシクリル部分およびフェニル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、アミノ、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、 N,N -ジ- $(C_1-C_6\text{-アルキル})$ アミノ、ヘテロシクリル、フェニル、式II：

【化13】



【0076】

(式中、

Qは、水素または C_1-C_6 -アルキルであり；

Yは、直接結合または C_1-C_6 -アルカンジイルであり；

R^8 は、アミノ、 C_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノ、 C_1-C_6 -アルキル、ヒドロキシ、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]、または C_1-C_6 -ハロアルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]である)

で表される部分から選択される1つ以上の基で置換されていてもよく；

XがOR⁴であり；

R⁴が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-ハロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、[N-(C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル),N-(C₁-C₆-アルキル)]-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-アルキニル-C₂-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₃-C₆-ハロアルキニル、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロシクリルカルボニル、フェニルカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、フェニルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル、フェニル-C₁-C₆-アルキルであり；ここでR⁴およびR⁵のフェニル部分およびヘテロシクリル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、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-アルコキシカルボニル、ヘテロシクリル、フェニルから選択される1つ以上の基で置換されていてもよい、

上記化合物およびそれらの農業上有用な塩である。

【0077】

除草剤としてさらに特に有用なのは、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物であって、式中、

R¹が水素であり；

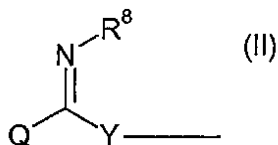
R²が、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキルであり；最も好ましくはシクロプロピルまたは1-フルオロシクロプロピルであり；

R³が、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ-C₁-C₆-アルキル、フェノキシ-C₁-C₆-アルキル、ヘテロシクリルオキシ-C₁-C₆-アルキル、フェニル-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-カルボニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、アミノ-C₁-C₆-アルキル、(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、N,N-ジ-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(C₃-C₆-シクロアルキル)]アミノ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ホルミル、ホルミル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-カルボニル、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、C₁-C₆-ハロアルキル-C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₁-C₆-ハロアルキル-C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルコキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキル-C₁-C₆-アルコキシ、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₆-アルケニルオキシ、C₃-C₆-ハロアルケニルオキシ、C₃-C₆-アルキニルオキシ、C₃-C₆-ハロアルキニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ、フェニル-C₁-C₆-アルコキシ、フェニル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルコキシ、ヘテロシクリル-C₁-C₆-ハロアルコキシ、フェノキシ、ヘテロシクリルオキシ、フェニルカルボニルオキシ、ヘテロシクリルカルボニルオキシ、フェニルアミノ、ヘテロシクリルアミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-フェニル]アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(C₃-C₆-シクロアルキル)]アミノ、N-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ、N,N-ジ-(C₃-C₆-シクロアルキル)アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)]アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(C₁-C₆-ハロアルキル)]アミノ、(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)アミノ、N,N-ジ-(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)アミノ、[N-(C₁-C₆-アルキル),N-(フェニル-C₁-C₆-アルキル)]アミノ、(フェニル-C₁-C₆-アル

キル)アミノ、(ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル)アミノ、N-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N,N-ジ-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N-[(C₃-C₆-ハロシクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノ、N-(C₁-C₆-アルキル)-N-[(C₃-C₆-シクロアルキル)-(C₁-C₆-アルキル)]アミノであり、ここで、R³のヘテロシクリル部分およびフェニル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、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、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)アミノ、ヘテロシクリル、フェニル、式II：

10

【化14】



【0078】

(式中、

Qは、水素またはC₁-C₆-アルキルであり；Yは、直接結合またはC₁-C₆-アルカンジイルであり；

20

R⁸は、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、C₁-C₆-アルキル、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]、またはC₁-C₆-ハロアルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]である)

で表される部分から選択される1つ以上の基で置換されていてもよく；

XがOR⁴であり；

R⁴が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-ハロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、N,N-ジ-(C₁-C₆-アルキル)-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、[N-(C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル), N-(C₁-C₆-アルキル)]-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-アルキニル-C₂-C₆-アルケニル、C₃-C₆-アルキニル、C₃-C₆-ハロアルキニル、ヘテロシクリル、フェニル、ヘテロシクリルカルボニル、フェニルカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、フェニルカルボニル-C₁-C₆-アルキル、ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキル、フェニル-C₁-C₆-アルキルであり；ここでR⁴およびR⁵のフェニル部分およびヘテロシクリル部分は、置換されていなくても、またはハロゲン、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-アルコキシカルボニル、ヘテロシクリル、フェニルから選択される1つ以上の基で置換されていてもよい、

30

40

上記化合物およびそれらの農業上有用な塩である。

【0079】

除草剤としてさらに特に有用なのは、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物であって、式中、

R¹が水素であり；

R²が、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキルであり；最も好ましくはシクロプロピルまたは1-フルオロシクロプロピルであり；

R³が、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、フェニルアミノ、N-(C₃-C₆-シクロアルキル)]アミノであり；

50

XがOR⁴であり；

R⁴が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₃-C₆-アルキニルである、
上記化合物およびそれらの農業上有用な塩である。

【0080】

除草剤としてさらに特に有用なのは、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物であって、式中、

R¹が水素であり；

R²が、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキルであり；最も好ましくはシクロプロピルまたは1-フルオロシクロプロピルであり；

R³が、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシであり；

XがOR⁴であり；

R⁴が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-シアノアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₃-C₆-アルキニルである、
上記化合物およびそれらの農業上有用な塩である。

【0081】

さらに、除草剤として有用なのは、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物であって、式中、

R¹が水素であり；

R²が、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキルであり；最も好ましくはシクロプロピルまたは1-フルオロシクロプロピルであり；

R³が、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、フェニルアミノ、N-(C₃-C₆-シクロアルキル)]アミノであり；

XがSR⁵であり；

R⁵が、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、フェニル-C₁-C₆-アルキルであり；最も好ましくはC₁-C₆-アルキル、フェニル-C₁-C₆-アルキルである、
上記化合物である。

【0082】

さらに、除草剤として有用なのは、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物であって、式中、

R¹が水素であり；

R²が、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキルであり；最も好ましくはシクロプロピルまたは1-フルオロシクロプロピルであり；

R³が、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシであり；

XがSR⁵であり；

R⁵が水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、フェニル-C₁-C₆-アルキルであり；最も好ましくはC₁-C₆-アルキル、フェニル-C₁-C₆-アルキルである、
上記化合物である。

【0083】

除草剤として最も特に有用なのは、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物であって、式中、

R¹が水素であり；

R²が、シクロプロピルまたは1-フルオロシクロプロピルであり；

R³が、C₃-C₆-シクロアルキルオキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキルオキシ、フェニルアミノ、N-(C₃-C₆-シクロアルキル)]アミノであり；

XがOR⁴であり；

R⁴が水素である、

上記化合物およびそれらの農業上有用な塩である。

10

20

30

40

50

【 0 0 8 4 】

また除草剤として最も特に有用なのは、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン化合物であって、式中、

R^1 が水素であり；

R^2 が、シクロプロピルまたは1-フルオロシクロプロピルであり；

R^3 が、 C_3 - C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルオキシ、フェニルアミノ、 N -(C_3 - C_6 -シクロアルキル)]アミノであり；

Xが SR^5 であり；

R^5 が、水素、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、フェニル- C_1 - C_6 -アルキルであり；

最も好ましくは C_1 - C_6 -アルキル、フェニル- C_1 - C_6 -アルキルである、

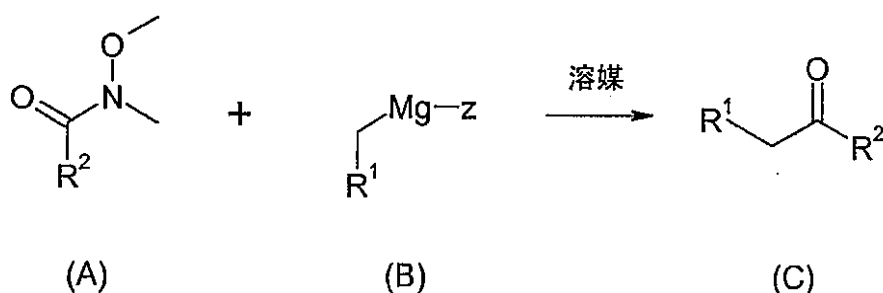
上記化合物である。

10

【 0 0 8 5 】

本発明による式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンは、有機化学の標準的な方法により、例えば、以下の方法：

【 化 1 5 】



20

によって調製することができる。

【 0 0 8 6 】

式(C)の化合物(式中、 R^1 は C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル、 C_2 - C_6 -アルケニル、 C_2 - C_6 -アルキニルまたはフェニル- C_1 - C_6 -アルキルである)は、式(B)の化合物(式中、Zはハロゲンである)を、不活性有機溶媒中で、 $-100 \sim 30$ の温度において、好ましくは $-80 \sim 0$ の温度において、最も好ましくは -78 において、アルゴンまたは窒素などの不活性ガス雰囲気下で式(A)の化合物に加えることによって調製することができる。反応混合物は、慣用の方法で、例えば水と混合し、相分離させ、抽出しさらに適切であれば、粗生成物を(好ましくは抽出により)クロマトグラフィー精製することによって後処理される。

30

【 0 0 8 7 】

好適な溶媒は、脂肪族炭化水素(例えばペンタン、ヘキサン、シクロヘキサンおよび C_5 - C_8 -アルカンの混合物)、芳香族炭化水素(例えばトルエン、o-、m-および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、クロロホルムおよびクロロベンゼン)、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、アニソールおよびテトラヒドロフラン)、ニトリル(例えばアセトリトリルおよびプロピオニトリル)、ならびにジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドおよびN,N-ジメチルアセトミドまたはN-メチルピロリドンである。

40

【 0 0 8 8 】

特に好ましいのは、テトラヒドロフランおよびジエチルエーテルである。上記の溶媒の混合物を使用することもできる。

【 0 0 8 9 】

式(A)の化合物は、文献から公知であり(Duncia, John Vら. Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters 2008, 18(2), 576-585, およびGao, S.ら Journal of the American Chemical Society 2010, 132(1), 371-383)、または、これらは引用される文献に従って調製することが可能であり、および/または市販されている。

【 0 0 9 0 】

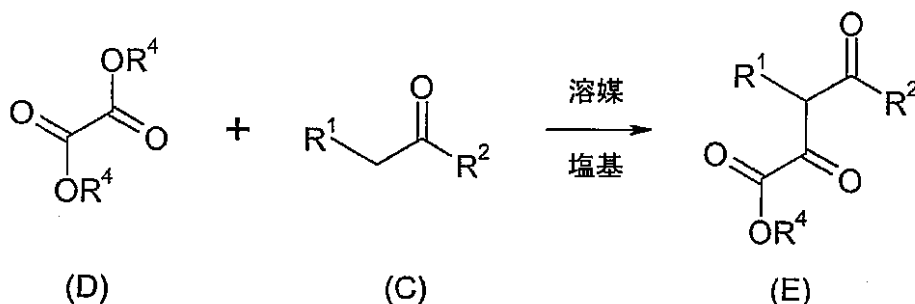
50

式(B)の化合物は市販されている。

【0091】

式(C)の化合物(式中、 R^2 は1-フルオロシクロプロピルであり、 R^1 は水素である)は、文献から公知である(DE 4206917)。

【化16】



10

【0092】

式(E)の化合物(式中、 R^4 は C_1 - C_6 -アルキルであり、 R^1 は、水素、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル、 C_2 - C_6 -アルケニル、 C_2 - C_6 -アルキニルまたはフェニル- C_1 - C_6 -アルキルである)は、化合物(D)と(C)の混合物を好適な塩基で処理することによって調製することができる。この反応は、不活性有機溶媒中で、 $-100 \sim 100$ の温度において、好ましくは $0 \sim 80$ の温度において行われる。

20

【0093】

好適な塩基は、一般に、無機化合物、例えばアルカリ金属およびアルカリ土類金属の水酸化物(例えば水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムおよび水酸化カルシウム)、アルカリ金属およびアルカリ土類金属の水素化物(例えば水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウムおよび水素化カルシウム)、アルカリ金属およびアルカリ土類金属の炭酸塩(例えば炭酸リチウム、炭酸カリウムおよび炭酸カルシウム)ならびにアルカリ金属重炭酸塩(例えば重炭酸ナトリウム)、アルカリ金属およびアルカリ土類金属のアルコキシド(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-ペントキシドおよびジメトキシマグネシウム)、およびさらに有機塩基、例えば第三級アミン(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および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-メチルモルホリンおよび4-ジメチルアミノピリジン)およびさらに二環式アミンである。

30

【0094】

特に好ましいのは、ナトリウムメトキシドおよびナトリウムエトキシドである。

【0095】

上記の塩基は、一般的に、等モル量または過剰で用いられる。

40

【0096】

好適な溶媒は、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、アニソールおよびテトラヒドロフラン)、ニトリル(例えばアセトニトリルおよ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-ブタノールおよびtert.-ブタノール、ならびにジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドおよびN,N-ジメチルアセトアミドまたはN-メチルピロリドンである)。

【0097】

特に好ましいのは、メタノールまたはエタノールである。上記の溶媒の混合物を使用することもできる。

50

【 0 0 9 8 】

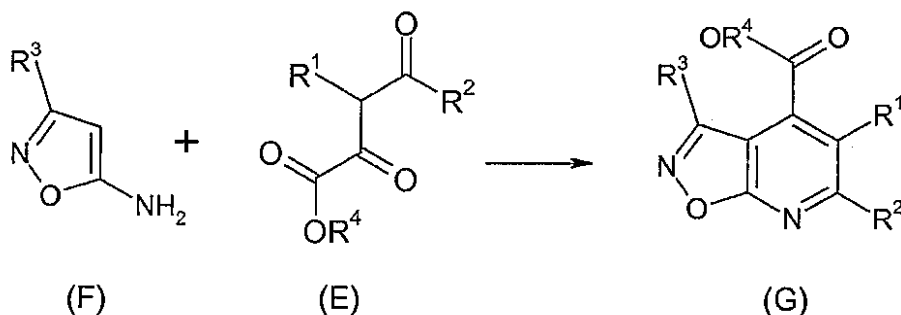
式(E)の化合物の調製に必要とされる好適な方法は、文献から公知である(Brecker, L. ら, New J. Chem., 1999, 23, 437-446)。式(E)の化合物の調製に必要とされる基質は市販されている。

【 0 0 9 9 】

式(E)の化合物(式中、 R^1 はハロゲンである)は、文献から公知の好適な方法によって製造することができる(Cao, L. ら Synlett 2009, 9, 1445-1448; Still, I. W. J. ら Journal of Organic Chemistry 1981, 46(24), 4911-14およびBanks, R. E. ら Journal of the Chemical Society, Chemical Communications 1994, 3, 343-344)。

【 化 1 7 】

10



【 0 1 0 0 】

20

式(G)の化合物は、式(E)の化合物と式(F)の化合物を、好適な溶媒中で、65 ~ 120 °C、最も好ましくは118 °Cの温度で混合することによって調製することができる。反応が完了した後、反応混合物を氷/水に注ぐ。形成された固体を濾過により回収し、高真空下で乾燥させる。

【 0 1 0 1 】

好適な溶媒は、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-ブタノールおよびtert.-ブタノール)、水、カルボン酸(例えばギ酸、氷酢酸)ならびにジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドおよびN,N-ジメチルアセトアミドまたはN-メチルピロリドンである。

【 0 1 0 2 】

30

特に好ましいのは氷酢酸である。

【 0 1 0 3 】

上記の溶媒の混合物を使用することもできる。

【 0 1 0 4 】

類似の方法は、例えば、Petrosyan, V. A. ら Russ.Chem.Bull., Int. Ed., 2007, 56, 2186-2188に記載されている。

【 0 1 0 5 】

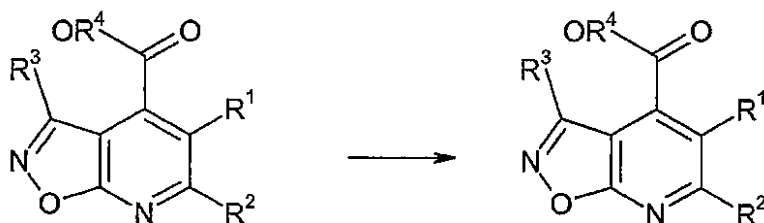
式(F)の化合物の製造に必要とされる好適な方法は、文献から公知である(Scott, K. R. European Journal of Medicinal Chemistry 2002, 37, 635-648; Mitsuhashi, K. Journal of Heterocyclic Chemistry, 1986, 23(5), 1535-8; Safir, S. R. Journal of Organic Chemistry 1965, 30(8), 2862-4; Dines, M. B. Tetrahedron Letters 1969, 54, 4817-4819; Katsura, M. Nitriles. IV. Synthesis of isoxasoles and pyrazoles from some three-carbon nitriles, Takeda Kenkyushoho 1971, 30(3), 475-92; Bauer, L.; Nambury, C. N. V. Journal of Organic Chemistry 1961, 26, 4917-22; EP 0220947; WO 2008034008; WO 2010094120)。

40

【 0 1 0 6 】

式(F)の化合物の幾つかは市販されている。

【化 18】

(G) R_1 = ハロゲン

(G)

10

【0107】

式(G)の化合物(式中、 R^1 は、ヒドロキシル、 C_1 - C_6 -アルコキシ- C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -ハロアルコキシである)は、式(G)の化合物(式中、 R^1 はハロゲンである)から、文献(例えば: Dejardin, J. V.ら Bulletin de la Societe Chimique de France 1976, 3-4, Pt. 2, 530-532, Ouyang, X.ら, Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters 2005, 15(23), 5154-5159およびMagee, T. V.ら Journal of Medicinal Chemistry 2009, 52(23), 7446-7457)から公知の好適な方法に従って調製することができる。

【0108】

式(G)の化合物(式中、 R^1 は水素であり、 R^3 は、 C_3 - C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルオキシである)は、 C_3 - C_6 -(ハロ)シクロアルキルアルコールおよび式(G)の化合物(式中、 R^1 は水素であり、 R^3 はOHである)に、ハロゲン化水素ピリジン、酸(最も好ましくは H_3PO_4)およびオキシハロゲン化リン(phosphoroxhalide)を加え、これを50 ~ 120 °C、最も好ましくは90 °Cの温度で1~5時間攪拌することによって製造することができる。過剰のオキシハロゲン化リン(phosphoroxhalide)を高真空下に蒸発させる。反応混合物は、慣用の方法で、例えば好適な溶媒およびアルカリ金属重炭酸塩の水溶液を加え、相分離させ、抽出しさらに適切であれば、粗生成物をクロマトグラフィー精製することによって後処理される。

20

【0109】

好適な溶媒は、酢酸エチル、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、クロロホルム、tert-ブチルメチルエーテル、ジイソプロピルエーテルである。好適なアルカリ金属重炭酸塩は、重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウム、重炭酸カルシウムである。

30

【0110】

式(G)の化合物(式中、 R^1 は水素であり、 R^3 は C_3 - C_6 -シクロアルキルオキシ、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルオキシである)は、 C_1 - C_6 -(ハロ)シクロアルキルアルコールと式(G)の化合物(式中、 R^1 は水素であり、 R^3 はOHである)とを、20 ~ 25 °C、最も好ましくは0 °Cの温度において、先に調製した好適な溶媒(好ましくはテトラヒドロフラン)中のジ- C_1 - C_6 -アルキルアゾジカルボキシレートとトリアリールホスフィン(最も好ましくはトリフェニルホスフィン)との攪拌溶液に加えることによって調製することができる。反応は、-20 ~ 100 °C、好ましくは40 ~ 80 °Cの温度で行う。反応混合物は、慣用の方法で、例えば、溶媒を真空下に除去し、粗生成物をクロマトグラフィー精製することによって後処理される。

40

【0111】

好適な溶媒は、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、アニソールおよびテトラヒドロフランである。特に好ましいのは、テトラヒドロフランおよびジエチルエーテルである。上記の溶媒の混合物を使用することもできる。

【0112】

式(G)の化合物(式中、 R^3 は、 C_3 - C_6 -アルケニルオキシ、 C_3 - C_6 -アルキニルオキシである)は、式(G)の化合物(式中、 R^3 はヒドロキシルである)とWX(式中、Xはハロゲンであり、Wは C_3 - C_6 -アルケニル、 C_3 - C_6 -アルキニルである)とを混合することによって調製することができる。この反応は、通常、0 ~ 120 °C、好ましくは20 ~ 50 °Cにおいて、塩基の存在

50

下、不活性有機溶媒中で行われる。反応混合物は、慣用の方法で、例えば好適な溶媒およびアルカリ金属重炭酸塩の水溶液を加え、相分離させ、抽出し、さらに適切であれば、粗生成物のクロマトグラフィー精製を行うことによって後処理される。

【0113】

好適な溶媒は、脂肪族炭化水素(例えばペンタン、ヘキサン、シクロヘキサンおよびC₅-C₈-アルカンの混合物)、芳香族炭化水素(例えば、トルエン、o-、m-および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、クロロホルムおよびクロロベンゼン)、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、アニソールおよびテトラヒドロフラン)、ニトリル(例えばアセトニトリルおよ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、ジエチルケトンおよびtert-ブチルメチルケトン)、ならびにジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドおよびN,N-ジメチルアセトアミドまたはN-メチルピロリドンである。

10

【0114】

特に好ましいのは、ジメチルホルムアミドである。

【0115】

上記の溶媒の混合物を使用することもできる。

【0116】

好適な塩基は、一般的に、無機化合物、例えばアルカリ金属およびアルカリ土類金属の炭酸塩(例えば、炭酸リチウム、炭酸カリウムおよび炭酸カルシウム)、ならびにアルカリ金属の重炭酸塩(例えば重炭酸ナトリウム、金属有機化合物)、好ましくはアルカリ金属のアルキル(例えばメチルリチウム、ブチルリチウム)、ならびにアルカリ金属およびアルカリ土類金属のアルコキシド(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-ペントキシドおよびジメトキシマグネシウム)、およびさらに有機塩基、例えば第三級アミン(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および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-メチルモルホリンおよび4-ジメチルアミノピリジン)およびまた二環式アミンである。

20

【0117】

特に好ましいのは炭酸カリウムである。

30

【0118】

塩基は、一般的に触媒量で用いられるが、等モル量で、過剰で、または適切であれば溶媒として使用することもできる。

【0119】

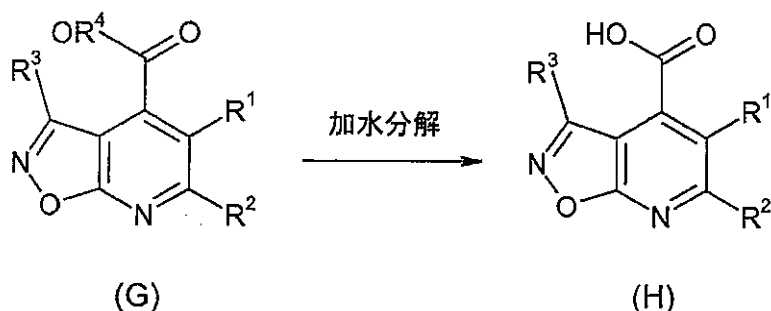
式(G)の化合物(式中、R³は、フェニルカルボニルオキシ、フェニル-C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ、ヘテロシクリルオキシである)の調製に必要とされる好適な方法は、文献から公知である(P.J. Kocienski, Protecting groups, Thieme, Stuttgart; 2005)。

【0120】

式(G)の化合物(式中、R³はフェノキシである)の調製に必要とされる好適な方法は、文献から公知である(Larock, R. C. Organic Letters 2004, 6(1), 99-102)。

40

【化 19】



10

【0121】

式(H)の化合物は、式(G)の化合物から、好適な酸または塩基触媒の存在下、0 ~ 80、最も好ましくは25 の温度で、通常加熱下またはマイクロ波照射下、好適な溶媒中で加水分解することによって調製することができる(例えば: Carrigan, C. N. J. Med. Chem. 2002, 45, 2260-2276およびGhosh, P. Journal of Teaching and Research in Chemistry 2008, 15(2), 54-57を参照)。

【0122】

好適な酸触媒は、フッ化水素酸、塩化水素酸、臭化水素酸、過塩素酸、硫酸などの無機酸である。

【0123】

特に好ましいのは、塩化水素酸および硫酸である。

20

【0124】

酸は、一般的に触媒量で用いられるが、等モル量または過剰で用いることもできる。

【0125】

好適な塩基触媒は、アルカリ金属およびアルカリ土類金属の水酸化物、例えば水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムおよび水酸化カルシウムである。

【0126】

特に好ましいのは、金属水酸化物、例えば水酸化ナトリウムである。

【0127】

塩基は、一般的に触媒量で用いられるが、等モル量または過剰で用いることもできる。

30

【0128】

好適な溶媒は、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、アニソールおよびテトラヒドロフラン)、水、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-ブタノールおよびtert.-ブタノール)ならびにジメチルスルホキシドである。

【0129】

特に好ましいのは、テトラヒドロフランである。

【0130】

上記の溶媒の混合物を使用することもできる。

【0131】

式(H)の化合物(式中、R³は、C₁-C₆-アルキルチオ、C₃-C₆-シクロアルキルチオ、C₃-C₆-ハロシクロアルキルチオ、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキルチオ、C₃-C₆-ハロシクロアルキル-C₁-C₆-アルキルチオ、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₃-C₆-ハロシクロアルキル-C₁-C₆-ハロアルキルチオ、ヘテロシクリルチオ、フェニルチオ、フェニル-C₁-C₆-アルキルチオ、ヘテロシクリル-C₁-C₆-アルキルチオである)は、引用される文献: Larock, R. C. ACS Combinatorial Science 2011, 13(5), 501-510に従って、または化合物(H)(式中、R³はハロゲンである)を、好適なチオール、パラジウム触媒、ホスフィンリガンドおよび塩基と、好適な溶媒中で一緒に混合することによって調製することができる。この反応は、不活性有機溶媒中で、0 ~ 100 の温度において、好ましくは25 ~ 85 の温度において行われる。反応混合物は、慣用の方法で、例えば水と混合し、

40

50

相分離させ、抽出し、さらに適切であれば、粗生成物をクロマトグラフィー精製することによって後処理される。

【0132】

好ましいのは、パラジウム触媒(例えば、パラジウム(II)酢酸塩、パラジウム(II)塩化物、アリルパラジウム(II)塩化物二量体、ビス(ベンゾニトリル)パラジウム(II)二塩化物、ビス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム(0)、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]パラジウム(II)二塩化物ジクロロメタン付加物、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)二塩化物、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)である。特に好ましいのは、パラジウム(II)酢酸塩である。

【0133】

好適なホスフィンリガンドは、(2,2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ビナフチル)、1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン、ビス(2-ジフェニルホスフィノフェニル)エーテル、ジ-*t*-ブチルメチルホスホニウムテトラフルオロホウ酸塩、2-(ジ-*t*-ブチルホスフィノ)ピフェニル、トリ-*t*-ブチルホスホニウムテトラフルオロホウ酸塩、トリ-2-フリルホスフィン、トリ(2,4-ジ-*t*-ブチルフェニル)垂リン酸塩、トリ-*o*-トリルホスフィン、(2*R*)-1-[(1*R*)-1-[ビス(1,1-ジメチルエチル)ホスフィノ]エチル]-2-(ジシクロヘキシルホスフィノ)-フェロセンである。

【0134】

特に好ましいのは、(2*R*)-1-[(1*R*)-1-[ビス(1,1-ジメチルエチル)ホスフィノ]エチル]-2-(ジシクロヘキシルホスフィノ)-フェロセンである。

【0135】

好適な塩基は、一般的に、無機化合物、例えば、アルカリ金属およびアルカリ土類金属の炭酸塩(例えば炭酸リチウム、炭酸カリウムおよび炭酸カルシウム)、アルカリ金属およびアルカリ土類金属のアルコキシド(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*-ペントキシドおよびジメトキシマグネシウム)およびさらに有機塩基、例えば第三級アミン(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および*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*-メチルモルホリンおよび4-ジメチルアミノピリジン)およびさらに、二環式アミンである。特に好ましいのは、カリウム*tert*-ブトキシドである。

【0136】

塩基は、一般的に、等モル量または過剰で用いられる。

【0137】

好適な溶媒は、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、1,2-ジメトキシエタン、ジオキサンおよびテトラヒドロフラン)ならびに芳香族炭化水素(例えば、ベンゼン、トルエン、*o*-、*m*-および*p*-キシレン)である。

【0138】

特に好ましいのは、1,2-ジメトキシエタンである。上記の溶媒の混合物を使用することもできる。

【0139】

式(H)の化合物(式中、 R^3 は、*N*-(C_1 - C_6 -アルキル)アミノ、*N*-[(C_3 - C_6 -シクロアルキル)-(C_1 - C_6 -アルキル)]アミノ、*N,N*-ジ-(C_1 - C_6 -アルキル)アミノ、*N*-(C_3 - C_6 -シクロアルキル)-(C_1 - C_6 -アルキル)アミノフェニルアミノ、*N*-(C_1 - C_6 -アルキル)-*N*-フェニル-アミノ、[*N*-(C_1 - C_6 -アルキル),*N*-(C_3 - C_6 -シクロアルキル)]アミノ、(C_3 - C_6 -シクロアルキル)アミノ、*N,N*-ジ-(C_3 - C_6 -シクロアルキル)アミノ、[*N*-(C_1 - C_6 -アルキル),*N*-(C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル)]アミノ、(C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル)アミノ、*N,N*-ジ-(C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル)アミノ、[*N*-(C_1 - C_6 -アルキル),*N*-(フェニル- C_1 - C_6 -アルキル)]アミノ、(フェニル- C_1 - C_6 -アルキル)アミノ、(ヘテロシクリル- C_1 - C_6 -アルキル)アミノである)は、好適なアミンと式(H)の化合物(式中、 R^3 はハロゲンである)とを、マイクロ波中で、1パール~30パール(

10

20

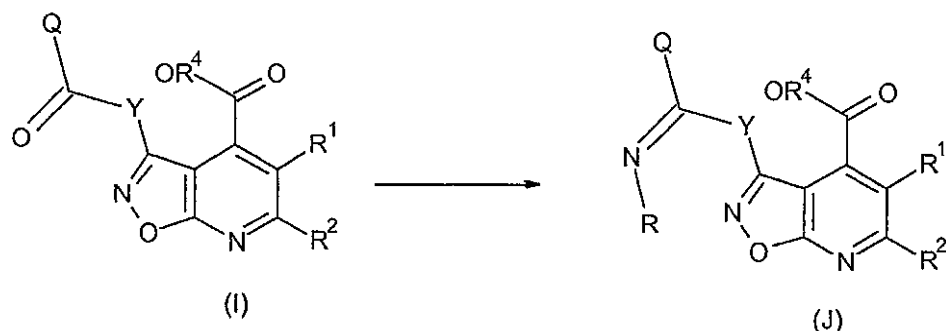
30

40

50

好ましくは5パール～10パール)で、65 ～120 (最も好ましくは120)にて混合することによって調製することができる。反応混合物を真空中で濃縮し、残渣を好適な溶媒(最も好ましくはジイソプロピルエーテルである)に溶解させる。形成された固体を濾過により回収し、高真空下で乾燥させる。

【化20】



10

【0140】

式(J)の化合物

(式中、

Qは、水素またはC₁-C₆-アルキルであり；

Yは、直接結合またはC₁-C₆-アルカンジイルであり；

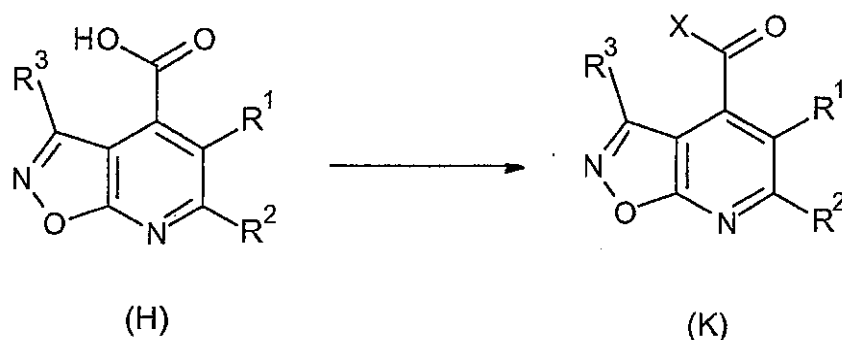
R⁸は、アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、C₁-C₆-アルキル、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]、またはC₁-C₆-ハロアルキル-[(アミノカルボニル)アミノ]である)

20

の調製に必要とされる好適な方法は、文献から公知である：

Stroh, H. H. Chemische Berichte 1957, 90, 352-7 ; Baltas, M. European Journal of Medicinal Chemistry 2010, 45(7), 3019-3026 ; Klein, D. X. Journal of Organic Chemistry 1957, 22, 951-4 ; Jayabalakrishnan, C. Journal of Coordination Chemistry 2010, 63(7), 1252-1262.

【化21】



30

【0141】

式(H)の化合物は、標準条件下で、エステル化し、チオエステル化して、式(K)の化合物(式中、Xは、OR⁴(例えば：Arnab, P.ら Angewandte Chemie, 国際版 2010, 49(8), 1492-1495を参照)、SR⁵(例えば：Silvestri, M. A.ら Journal of Medicinal Chemistry 2004, 47(12), 3149-3162を参照)、NR⁶R⁷(例えば：Kuhn, B.ら Journal of Medicinal Chemistry 2010, 53(6), 2601-2611を参照)である)のアミドまたは酸ハロゲン化物(好ましくは酸塩化物)に変換することができる。

40

【0142】

式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン、除草剤として適している。これらは、それ自体で、または適切に製剤化された組成物(除草組成物)として適している。本願で使用される用語「製剤化組成物」および「除草組成物」は、同意語である。

50

【 0 1 4 3 】

式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンを含む除草剤組成物は、とりわけ高施用量において、非作物区域の植生を極めて効率的に防除する。この除草剤は、コムギ、イネ、トウモロコシ、ダイズおよびワタなどの作物における広葉雑草および雑草イネ科雑草に対して、上記の作物にはなんら重大な損傷を引き起こすことなく作用する。この効果は主に低施用量で観察される。

【 0 1 4 4 】

当該施用方法にもよるが、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンまたはそれらを含む組成物は、さらなる種類の作物において、望ましくない植物の除去にさらに用いることができる。適する作物の例は、以下のとおりである：

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・ヒボゲア(*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・ダクチロン(*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・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・マックス(*Glycine max*; ダイズ)、ゴシッピウム・ヒルスツム(*Gossypium hirsutum*; リクチワタ)(ゴシッピウム・アルボレウム(*Gossypium arboreum*; キダチワタ)、ゴシッピウム・ヘルバケウム(*Gossypium herbaceum*; アジアワタ)、ゴシッピウム・ビチフォルリウム(*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)、リコペルシコン・リコペルシカム(*Lycopersicon lycopersicum*; トマト)、マルス種(*Malus* spec.; リンゴ属の品種)、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)、ムサ種(*Musa* spec.; バナナ属の品種)、ニコチアナ・タバクム(*Nicotiana tabacum*; タバコ)(ニコチアナ・ルスチカ(*N. rustica*; マルバタバコ))、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)、ピナス種(*Pinus* spec.; マツ属の品種)、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・ケラスス(*Prunus cerasus*; サクラ)、プルナス・デュルシス(*Prunus dulcis*;アーモンド)およびプルナス・ドメスチカ(*Prunus domestica*; ブルーン)、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・セレアレ(*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)(ソルガム・ブルガレ(*s. 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)、ビシア・ファバ(*Vicia faba*; ソラマメ)、ビティス・ビニフェラ(*Vitis vinifera*; ブドウ)、およびゼア・マイス(*Zea mays*; トウモロコシ)。

10

【0145】

好ましい作物は、以下：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・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))、シノドン・ダクチドン(*Cynodon dactylon*; ギョウギシバ)、グリシン・マックス(*Glycine max*; ダイズ)、ゴシッピウム・ヒルスツム(*Gossypium hirsutum*; リクチワタ)(ゴシッピウム・アルボレウム(*Gossypium arboreum*; キダチワタ)、ゴシッピウム・ヘルバケウム(*Gossypium herbaceum*; アジアワタ)、ゴシッピウム・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)、ホルデウム・ブルガレ(*Hordeum vulgare*; オオムギ)、ジュグラン・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)、マルス種(*Malus spec.*; リンゴ属の品種)、メジカゴ・サチバ(*Medicago sativa*; アルファルファ)、ニコチアナ・タバクム(*Nicotiana tabacum*; タバコ)(ニコチアナ・ルスチカ(*N. 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)、プルヌス・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・セレアレ(*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)(ソルガム・ブルガレ(*s. vulgare*; ホウキモロコシ))、トリチカレ(*Triticale*; ライコムギ)、トリチウム・アエスティバム(*Triticum aestivum*)、トリチウム・デュラム(*Triticum durum*; マカロニコムギ)、ビシア・ファバ(*Vicia faba*; ソラマメ)、ビティス・ビニフェラ(*Vitis vinifera*; ブドウ)、およびゼア・マイス(*Zea mays*; トウモロコシ)である。

20

30

40

【0146】

本発明による式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンは、遺伝子改変植物にも使用することができる。用語「遺伝子改変植物」は、その遺伝物質が、組み換えDNA技術の使用によって、自然環境下では、交雑育種、突然変異または自然組み換えによっては容易に得ることができないように改変されている植物であると理解されたい。典型的には、植物の特定の特性を改良するために1つ以上の遺伝子が遺伝子改変植物の遺伝物質に組み込まれている。そのような遺伝子改変は、限定するものではないが、例えば、グリコシル化またはポリマー付加(プレニル化、アセチル化またはファルネシル化部分もしくはPEG部分の付加など)によるタンパク質、オリゴペプチドまたはポリペプチドの標的化翻訳後修飾も含む。

【0147】

50

従来の育種法または遺伝子操作法の結果として、育種、突然変異または遺伝子組み換えによって改変されている植物、例えば特定の種類の除草剤、例えばオーキシシン除草剤(ジカンバまたは2,4-Dなど)；白化除草剤(ヒドロキシフェニルビルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)阻害剤またはフィトエン不飽和化酵素(PDS)阻害剤など)；アセト乳酸合成酵素(ALS)阻害剤(スルホニル尿素またはイミダゾリノン類など)；エノールビルビルシキメート-3-ホスフェート合成酵素(EPSPS)阻害剤(グリホサートなど)；グルタミン合成酵素(GS)阻害剤(グルホシネートなど)；プロトボルフィリノーゲン-IX酸化酵素阻害剤；脂質生合成阻害剤(アセチルCoAカルボキシルラーゼ(ACCアーゼ)阻害剤など)；またはオキシニル(すなわちプロモオキシニルまたはイオキシニル)除草剤の施用に対して耐性にされている植物；さらに植物は、多重遺伝子改変を通じて多数種の除草剤に対して抵抗性にされており、例えば、グリホサートとグルホシネートの両方に対する抵抗性またはグリホサートと別の種類の除草剤(ALS 阻害剤、HPPD阻害剤、オーキシシン除草剤、またはACCアーゼ阻害剤など)の両方に対する抵抗性を有する。これらの除草剤抵抗性技術は、例えばPest Management Science 61, 2005, 246； 61, 2005, 258； 61, 2005, 277； 61, 2005, 269； 61, 2005, 286； 64, 2008, 326； 64, 2008, 332； Weed Science 57, 2009, 108； Australian Journal of Agricultural Research 58, 2007, 708； Science 316, 2007, 1185；およびこれらの文献中で引用されている参考文献に記載されている。いくつかの栽培植物は、従来の育種法(突然変異誘発)によって除草剤耐性となっており、例えば、イミダゾリノン系(例えばイマザモックス)に耐性のあるClearfield(登録商標)セイヨウアブラナ(キャノーラ(Canola)、BASF SE, Germany)、またはスルホニル尿素(例えばトリベニユロン)に耐性のあるExpressSun(登録商標)ヒマワリ(DuPont, USA)がある。遺伝子操作法は、ダイズ、ワタ、トウモロコシ、ビートおよびセイヨウアブラナなどの栽培植物を、グリホサート、イミダゾリノンおよびグルホシネートなどの除草剤に対して耐性にするために使用されており、これらの栽培植物の一部は、開発中であるか、あるいはRoundupReady(登録商標)(グリホサート耐性、Monsanto, USA)、Cultivance(登録商標)(イミダゾリノン耐性、BASF SE, Germany)およびLibertyLink(登録商標)(グルホシネート耐性、Bayer CropScience, Germany)という商標または商品名で市販されている。

10

20

30

40

50

【0148】

さらに、組み換えDNA技術の使用によって、1種以上の殺虫タンパク質、とりわけ細菌バチルス属(特にはバチルス・チューリンゲンシス(*Bacillus thuringiensis*))由来であることが知られている殺虫タンパク質、例えば、アルファ-エンドトキシン類(例えばCryIA(b)、CryIA(C)、CryIF、CryIF(a2)、CryIIA(b)、CryIIIA、CryIIIB(b1)またはCry9C)；植物性殺虫タンパク質(VIP)(例えばVIP1、VIP2、VIP3またはVIP3A)；細菌コロニー形成性線虫(例えば、フォトラブダス属の種(*Photorhabdus* spp.)またはゼノラブダス属の種(*Xenorhabdus* spp.))の殺虫タンパク質；動物によって産生される毒素(例えば、サソリ毒、クモ毒、スズメバチ毒、または他の昆虫特異的神経毒)；真菌によって産生される毒素(例えばストレプトミセス毒)、植物レクチン(例えばエンドウレクチンまたはオオムギレクチン)；アグルチニン；プロテイナーゼ阻害剤(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、シスタチン阻害剤またはパパイン阻害剤)；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、アブリン、ルフイン、サボリンまたはブリオジン)；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、エクジソン阻害剤またはHMG-CoA-レダクターゼ)；イオンチャネルブロッカー(例えば、ナトリウムチャネルブロッカーまた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)；スチルベンシンターゼ、ピベンジルシンターゼ、キチナーゼまたはグルカナーゼ；を合成することができる植物も包含される。本発明の文脈において、これらの殺虫タンパク質または毒素は、前毒素、ハイブリッドタンパク質、切断型タンパク質あるいは改変型タンパク質としても明示的に理解されたい。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によって特徴付けられる(例えばWO 02/015701を参照)。このような毒素またはこのような毒素を合

成し得る遺伝子改変植物のさらなる例は、例えば、EP-A 374753、WO 93/007278、WO 95/34656、EP-A 427529、EP-A 451878、WO 03/018810、およびWO 03/052073に開示されている。このような遺伝子改変植物の作製方法は当業者に一般的に知られており、例えば、上記の刊行物に記載されている。遺伝子改変植物に含まれるこれらの殺虫タンパク質は、これらのタンパク質を生産する植物に、節足動物の全ての分類群、特に甲虫類(鞘翅目)、双翅昆虫類(双翅目)および蛾類(鱗翅目)ならびに線虫類(線虫綱)の有害生物に対する耐性を与える。1種以上の殺虫タンパク質を合成することができる遺伝子改変植物は、例えば上記の刊行物に記載され、その一部は市販されており、例えば以下のものが挙げられる: YieldGard(登録商標)(Cry1Ab毒素を生成するトウモロコシ品種)、YieldGard(登録商標)Plus(Cry1Ab毒素およびCry3Bb1毒素を生成するトウモロコシ品種)、Starlink(登録商標)(Cry9c毒素を生成するトウモロコシ品種)、Herculex(登録商標)RW(Cry34Ab1、Cry35Ab1およ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]を生成するトウモロコシ品種); NuCOTN(登録商標)33B(Cry1Ac毒素を生成するワタ品種)、Bollgard(登録商標)I(Cry1Ac毒素を生成するワタ品種)、Bollgard(登録商標)II(Cry1Ac毒素およびCry2Ab2毒素を生成するワタ品種); VIPCOT(登録商標)(VIP毒素を生成するワタ品種); NewLeaf(登録商標)(Cry3A毒素を生成するジャガイモ品種); Syngenta Seeds SAS(フランス)から市販されている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)ならびにBt176(Cry1Ab毒素およびPAT酵素を生成するトウモロコシ品種)、Syngenta Seeds SAS(フランス)から市販されているMIR604(改変型Cry3A毒素を生成するトウモロコシ品種、WO 03/018810を参照)、Monsanto Europe S.A.(ベルギー)から市販されているMON 863(Cry3Bb1毒素を生成するトウモロコシ品種)、Monsanto Europe S.A.(ベルギー)から市販されているIPC531(改変型Cry1Ac毒素を生成するワタ品種)およびPioneer Overseas Corporation(ベルギー)から市販されている1507(Cry1F毒素およびPAT酵素を生成するトウモロコシ品種)。

10

20

30

40

50

【0149】

さらに、組み換えDNA技術の使用によって、細菌性、ウイルス性または真菌性病原体に対する植物の抵抗性または耐性を増加させるタンパク質を1種以上合成することができる植物も包含される。このようなタンパク質の例は、いわゆる「病原性関連タンパク質」(PRタンパク質、例えばEP-A 0392225を参照)、植物病抵抗性遺伝子(例えば、メキシコ産野生種ジャガイモであるソラヌム・ブルボカスタヌム(*Solanum bulbocastanum*)に由来する、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するジャガイモ品種)またはT4-リゾチーム(例えば、火傷病菌エルウィニア・アミロボラ(*Erwinia amylovora*)のような細菌に対して増強された抵抗性を有するこれらのタンパク質を合成することができるジャガイモ品種)である。かかる遺伝子改変植物の作製方法は当業者に一般的に知られており、例えば、上記の刊行物に記載されている。

【0150】

さらに、組み換えDNA技術の使用によって、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); 乾燥、塩害や他の生長制限環境因子に対する植物の耐性; あるいは有害生物および真菌、細菌またはウイルス病原体に対する植物の耐性を増加させる1種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。

【0151】

さらに、組み換えDNA技術の使用によって、特にヒトまたは動物の栄養摂取を改善するために、改変量の含有物または新規含有物を含む植物、例えば健康を促進する長鎖オメガ-3脂肪酸または不飽和オメガ-9脂肪酸を産生する油料作物(例えばNexera(登録商標)アブラナ、Dow AgroSciences, Canada)も包含される。

【0152】

さらに、組み換えDNA技術の使用によって、特に原料生産を改善するために、改変量の含有物または新規含有物を含む植物、例えば増加量のアミロペクチンを生産するジャガイモ(例えばAmflora(登録商標)ジャガイモ, BASF SE, Germany)も包含される。

【0153】

さらに、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンは、植物部分の落葉および/または乾燥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、ダイズまたはソラマメ等の作物(特にはワタ)が適している。これに関連して、植物を乾燥および/または落葉させるための組成物、これらの組成物の調製方法、ならびに式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンを用いて植物を乾燥および/または落葉させる方法が見出されている。

【0154】

乾燥剤として、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンは、ジャガイモ、ナタネ、ヒマワリおよびダイズなどの作物のみならず、穀類の地上部分を乾燥させるのにも特に適している。これにより、これらの重要な作物の完全機械収穫が可能となる。

10

【0155】

収穫を容易にすることも経済的関心事であり、これは、柑橘類果実、オリーブおよび他の種ならびにさまざまな仁果類果実、核果および堅果の裂開、すなわち木への付着の低下を一定期間内に集中させることによって可能となる。有用植物(特にはワタ)の落葉の制御のため、上記と同じ機序、すなわち植物の果実部分または葉部分と苗条部分との間の器官脱離組織の発達促進も重要である。

【0156】

さらには、個々のワタ植物が成熟する時間間隔の短縮は、収穫後の繊維品質の向上をもたらす。

20

【0157】

式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン、または式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンを含む除草剤組成物は、例えば、直ぐに散布可能な水性液剤、粉剤、フロアブル剤、さらには高濃度水性、油性もしくは他のフロアブル剤または分散剤、エマルジョン製剤、油性分散剤、ペースト剤、散粉剤、広域散布用物質、あるいは粒剤の形態で、散布、噴霧、散粉、広域散布、散水または種子処理(すなわち種子との混合)により使用することができる。使用剤形は、意図される目的によって決まるが、いずれの場合も、本発明による活性成分が確実に可能な限り微細に分散されるようなものであるべきである。

【0158】

この除草剤組成物は、除草有効量の少なくとも1種の式Iの式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン、および作物保護剤の製剤化において慣用される助剤を含む。

30

【0159】

作物保護剤の製剤化で慣用される助剤の例は、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、湿潤剤および粘着性付与剤)、有機増粘剤および無機増粘剤、殺細菌剤、凍結防止剤、消泡剤、場合により着色剤、ならびに種子製剤用の付着剤である。

【0160】

当業者であればかかる製剤の処方に十分に精通している。

【0161】

増粘剤(すなわち、製剤に改変された流動特性、すなわち静止状態では高粘度、および運動中は低粘度を付与する化合物)の例は、多糖類(例えばキサンタンガム(Kelcoから販売されているKelzan(登録商標))、Rhodopol(登録商標)23(Rhone Poulenc)またはVeegum(登録商標)(R.T. Vanderbiltから販売))ならびにまた有機および無機の層状鉱物(例えばAttaclay(登録商標)(Engelhardtから販売))である。

40

【0162】

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

【0163】

水性除草製剤を安定化させるため、殺細菌剤を加えることができる。殺細菌剤の例は、

50

ジクロロフェンおよびベンジルアルコールヘミホルマールをベースとする殺細菌剤(ICIから販売のProxel(登録商標)またはThor Chemieから販売のActicide(登録商標)RSおよびRohm&Haasから販売のKathon(登録商標)MK)ならびにまた、アルキルイソチアゾリノンおよびベンゾイソチアゾリノンなどのイソチアゾリノン誘導体をベースとする殺細菌剤(Thor Chemieから販売のActicide MBS)である。

【0164】

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、尿素またはグリセロールである。

【0165】

着色剤の例は、難水溶性顔料と水溶性色素の両方である。例として、ローダミンB、C.I.ピグメントレッド112およびC.I.ソルベントレッド1の名称で知られる色素、ならびにまた、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、ベーシックバイオレット10、ベー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、ベーシックレッド10、ベーシックレッド108が挙げられる。

【0166】

付着剤の例は、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアセテート、ポリビニルアルコールおよびチロースである。

【0167】

好適な不活性助剤は、例えば、以下のとおりである：

中～高沸点の鉱油留分(例えばケロシンおよびディーゼルオイル、さらにはコールタールオイル)および植物または動物由来の油、脂肪族炭化水素、環状炭化水素および芳香族炭化水素(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およびそれらの誘導体、アルキル化ベンゼンおよびそれらの誘導体)、アルコール(例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールおよびシクロヘキサノール)、ケトン(例えばシクロヘキサノン)または強極性溶媒(例えばN-メチルピロリドンなどのアミン)、ならびに水である。

【0168】

好適な担体としては、液体担体および固体担体が挙げられる。

液体担体としては、例えば、環状炭化水素および芳香族炭化水素などの非水性溶媒(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およびそれらの誘導体、アルキル化ベンゼンおよびそれらの誘導体)、アルコール(例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールおよ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-メチルピロリドンなどのアミン)、および水ならびにこれらの混合物が挙げられる。

【0169】

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、膠灰粘土、黄土、粘土、ドロマイト、珪藻土、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウムおよび酸化マグネシウム)、粉碎された合成材料、肥料(例えば硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウムおよび尿素)、ならびに植物起源の製品(例えば穀粉、樹皮粉、木粉、堅果殻粉)、セルロース粉末、あるいは他の固体担体が挙げられる。

【0170】

好適な界面活性剤(補助剤、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型、Borregaard)、フェノールスルホン酸、ナフタレンスルホン酸(Morwet型、Akzo Nobel)およびジブチルナフタレンスルホ

10

20

30

40

50

ン酸(Nekal型、BASF AG)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およびアンモニウム塩；アルキルスルホン酸塩およびアルキルアリールスルホン酸塩、アルキル硫酸塩、ラウリルエーテル硫酸塩および脂肪アルコール硫酸塩、ならびに硫酸化ヘキサデカノール、ヘプタデカノールおよびオクタデカノールの、さらにまた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およびその誘導体とホルムアルデヒドの縮合物、ナフタレンまたはナフタレンスルホン酸とフェノールおよ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ノールエーテル、エトキシ化イソオクチルフェノール、エトキシ化オクチルフェノールまたはエトキシ化ノニルフェノール、アルキルフェニルもしくはトリブチルフェニルポリグリコールエーテル、アルキルアリー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、エトキシ化ヒマシ油、ポリオキシエチレンアルキルエーテルまた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テート、ソルビトールエステル、リグノ亜硫酸塩廃液ならびにタンパク質、変性タンパク質、多糖類(例えばメチルセルロース)、疎水性修飾デンプン、ポリビニルアルコール(Mowiol型Clariant)、ポリカルボキシレート(BASF AG、Sokalan型)、ポリアルコキシレート、ポリビニルアミン(BASF AG、Lupamine型)、ポリエチレンイミン(BASF AG、Lupasol型)、ポリビニルピロリドンおよびそのコポリマーである。

10

【0171】

粉剤、広域散布用物質および散粉剤は、本発明の活性成分を固体担体と共に混合し、または同時に粉砕することによって調製することができる。

20

【0172】

粒剤、例えば被覆粒剤、含浸粒剤および均質粒剤は、本発明の活性成分を固体担体に結合させることによって調製することができる。

【0173】

水性の使用形態は、乳剤、フロアブル剤、ペースト剤、粉末水和剤または顆粒水和剤から、水を加えることによって調製することができる。

【0174】

エマルション剤、ペースト剤または油性分散剤を調製するためには、そのままの、または油もしくは溶媒に溶解させた式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンを、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤または乳化剤を用いて、水中で均質化することができる。別法として、活性化合物、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤または乳化剤、また所望の場合、溶媒または油を含む濃縮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。

30

【0175】

直ぐに使用可能な調製物(製剤)中の式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンの濃度は、広範囲で変動し得る。一般的には、製剤は、約0.001~98重量%、好ましくは0.01~95重量%の少なくとも1種の活性成分を含む。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)で用いられる。

【0176】

本発明による式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンの製剤中では、活性成分(例えば式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジン)は懸濁、乳化または溶解形態で含まれる。本発明による製剤は、水性液剤、粉剤、フロアブル剤、さらには高濃度の水性、油性または他のフロアブル剤または分散剤、水性エマルション剤、水性マイクロエマルション剤、水性懸濁エマルション剤、油性分散剤、ペースト剤、散粉剤、広域散布用物質または粒剤の形態であり得る。

40

【0177】

本発明による式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンは、例えば、以下のとおりに製剤化することができる：

1. 水で希釈する製品

A 液剤(Water-soluble concentrates)

10重量部の活性化合物を90重量部の水または水溶性溶媒に溶解させる。別法として、湿潤

50

剤または他の補助剤を加える。活性化合物は水で希釈すると溶解する。これにより活性化合物含量が10重量%の製剤が得られる。

【0178】

B 分散剤(Dispersible concentrates)

20重量部の活性化合物を、70重量部のシクロヘキサノンに10重量部の分散剤(例えばポリビニルピロリドン)を加えて溶解させる。水で希釈すると分散液が得られる。活性化合物含量は20重量%である。

【0179】

C 乳剤(Emulsifiable concentrates)

15重量部の活性化合物を、75重量部の有機溶媒(例えばアルキル芳香族)に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レート(いずれも5重量部)を加えて溶解させる。水で希釈すると乳液が得られる。この製剤は15重量%の活性化合物含量を有する。

【0180】

D エマルション剤(Emulsions)

25重量部の活性化合物を、35重量部の有機溶媒(例えばアルキル芳香族)に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レート(いずれも5重量部)を加えて溶解させる。この混合物を乳化装置(例えばUltraturrax)を用いて30重量部の水中に導入し、均質なエマルションとする。水で希釈すると乳液が得られる。この製剤は25重量%の活性化合物含量を有する。

【0181】

E フロアブル剤(Suspensions)

攪拌下にあるボールミル中で、20重量部の活性化合物に10重量部の分散剤および湿潤剤ならびに70重量部の水または有機溶媒を加えて粉碎することにより、活性化合物の微細懸濁液が得られる。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量は20重量%である。

【0182】

F 顆粒水和剤および顆粒水溶剤(Water-dispersible granules and water-soluble granules)

50重量部の活性化合物に50重量部の分散剤および湿潤剤を加えて微粉碎し、専用の装置(例えば押出機、噴霧塔、流動床)を用いて顆粒水和剤または顆粒水溶剤とする。水で希釈すると活性化合物の安定な分散液または溶液が得られる。この製剤は50重量%の活性化合物含量を有する。

【0183】

G 粉末水和剤および粉末水溶剤(Water-dispersible powders and water-soluble powders)

ローター・ステーターミル内で、75重量部の活性化合物に25重量部の分散剤、湿潤剤および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分散液または溶液が得られる。この製剤の活性化合物含量は75重量%である。

【0184】

H ゲル剤(Gel formulations)

ボールミル内で、20重量部の活性化合物、10重量部の分散剤、1重量部のゲル化剤および70重量部の水または有機溶媒を混合して微細懸濁液が得られる。水で希釈すると活性化合物含量が20重量%の安定な懸濁液が得られる。

【0185】

2. 希釈せずに施用する製品

I 散粉剤(Dusts)

5重量部の活性化合物を微粉碎し、95重量部の微粉碎カオリンと充分に混合する。これにより活性化合物含量が5重量%の散粉製品が得られる。

【0186】

J 粒剤(Granules)(GR、FG、GG、MG)

0.5重量部の活性化合物を微粉碎し、99.5重量部の担体と組み合わせる。この場合の現在の方法は、押出、噴霧乾燥または流動床である。これにより活性化合物含量が0.5重量%の希釈せずに施用する粒剤が得られる。

【0187】

K ULV液剤(ULV solutions)(UL)

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量が10重量%の希釈せずに施用する製品が得られる。

【0188】

水性の使用形態は、乳剤、フロアブル剤、ペースト剤、粉末水和剤または顆粒水和剤から、水を加えることによって調製することができる。

10

【0189】

式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンまたはそれらを含む除草剤組成物は、出芽前、出芽後または植物体になる前に、あるいは作物の種子と一緒に施用することができる。本発明の除草剤組成物または活性化合物は、本発明の除草剤組成物または活性化合物で前処理された、作物の種子に施用することによって施用することもできる。本活性成分に対して、特定の作物による耐性が低い場合、散布装置の助けを得て、装置が感受性の高い作物の葉と接触しないようにできるだけ離しつつ、本活性成分が、その下で生長している望ましくない植物の葉、またはむき出しの土壌表面に届くように除草剤組成物を噴霧する施用技術(出芽後局部施用(post-directed)、レイバイ(lay-by))を用いることができる。

【0190】

20

さらなる実施形態において、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンまたはその除草剤組成物は、種子を処理することによって施用することができる。種子の処理は、基本的には、本発明による式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンまたはそれらから調製される組成物をベースとする、当業者が熟知しているあらゆる手法(種子粉衣(dressing)、種子コーティング(coating)、種子散粉(dusting)、種子浸漬(soaking)、種子フィルムコーティング(film coating)、種子多層コーティング(multilayer coating)、種子被殻(encrusting)、種子滴下(dripping)および種子ペレット化(pelleting))を包含する。種子処理では、除草剤組成物は、希釈して、または希釈せずに施用することができる。

【0191】

用語「種子」は、例えば、穀物、種子、果実、塊茎、実生および類似の形態などのあらゆる種類の種子を包含する。種子処理では、好ましくは、用語「種子」は、穀物および種子を表す。

30

【0192】

使用される種子は、上記の有用植物の種子であってよく、トランスジェニック植物または慣用の育種法によって得られる植物の種子であってもよい。

【0193】

本発明による活性な式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンの施用量(式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンの全量)は、防除標的、季節、標的植物および生長段階に応じて、1ヘクタール(ha)当たり活性物質(a.s.)0.1g~3000g、好ましくは10g~1000gである。

【0194】

40

本発明の別の好ましい実施形態において、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンの施用量は、1ヘクタール(ha)当たり活性物質(a.s.)0.1g~5000gおよび好ましくは1g~2500gまたは5g~2000gの範囲内である。

【0195】

本発明の別の好ましい実施形態において、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンの施用量は、1ヘクタール(ha)当たり活性物質0.1~1000g、好ましくは1~750g、より好ましくは5~500gである。

【0196】

種子を処理するためには、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンは、一般的に、種子100kg当たり0.001~10kgの量で用いられる。

50

【0197】

活性スペクトルを広げるため、さらに相乗効果を達成するため、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンは、多数の代表的な他の除草活性成分群または生長調節活性成分群と混合して、同時に施用することができる。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、アミノリン酸およびその誘導体、アミノトリアゾール、アニリド、(ヘト)アリールオキシアルカン酸およびその誘導体、安息香酸およびその誘導体、ベンゾチアジアジノン、2-アロイル-1,3-シクロヘキサンジオン、2-ヘタロイル-1,3-シクロヘキサンジオン、ヘタリールアリールケトン、ベンジルイソオキサゾリジノン、メタ-CF₃-フェニル誘導体、カーバメート、キノリンカルボン酸およびその誘導体、クロロアセトアニリド、シクロヘキ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およびその誘導体、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、ハロカルボン酸およびその誘導体、尿素、3-フェニルウラシル、イミダゾール、イミダゾリノン、N-フェニル-3,4,5,6-テトラヒドロフタルイミド、オキサジアゾール、オキシラン、フェノール、アリールオキシフェノキシプロピオン酸エステルおよびヘタリールオキシフェノキシプロピオン酸エステル、フェニル酢酸およびその誘導体、2-フェニルプロピオン酸およびその誘導体、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およびその誘導体、ピリミジエーテル、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、ウラシル、フェニルピラゾリンおよびイソオキサゾリンならびにその誘導体である。

10

20

【0198】

さらに、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンを単独でまたは他の除草剤と組み合わせ、あるいはそうでなければ他の作物保護剤との混合物の形態で(例えば有害生物または植物病原性真菌もしくは細菌の防除剤と一緒に)施用するのも有益であり得る。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興味深い。非植物毒性油や油濃縮剤などの他の添加剤を加えてもよい。

【0199】

さらに、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンを、薬害軽減剤と組み合わせて施用することも有用であり得る。薬害軽減剤は、式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンの、望ましくない植物に対する除草作用に大きく影響を及ぼすことなく、有用植物に対する損傷を予防または低下させる化合物である。これらは、有用植物の播種前(例えば、種子、苗条または実生の処理において)あるいは出芽前施用または出芽後施用のいずれかにおいて施用することができる。薬害軽減剤および式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンは、同時にまたは連続して施用することができる。

30

【0200】

好適な薬害軽減剤は、例えば、(キノリン-8-オキシ)酢酸、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、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、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、ジクロロアセトアミド、アルファ-オキシイミノフェニルアセトニトリル、アセトフェノンオキシム、4,6-ジハロ-2-フェニルピリミジン、N-[[4-(アミノカルボニル)フェニル]スルホニル]-2-ベンズアミド、1,8-ナフタル酸無水物、2-ハロ-4-(ハロアルキル)-5-チアジアゾールカルボン酸、ホスホロチオエート、N-アルキル-0-フェニルカーバメートおよび2-オキソ-ニコチンアミドならびにそれらの農業上好適な塩、およびそれらが酸機能を有していると想定して、それらの農業上好適な誘導体(例えば、アミド、エステルおよびチオエステル)である。

40

【0201】

本明細書中の以下に、代表的な式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンの調製を実施例によって示す：

NMRスペクトルは、Bruker Avance II 300上で記録した。

LC-MSは、以下の条件で、ウォーターズ・システム(Waters system)上で記録した：

50

カラム：XTerra MS C₁₈ 5 μm (4.6x100mm)

勾配：95% H₂O/5% メタノール～100% メタノール(8分)

流速：1.5mL/分

別法として、Shimadzu LCMS 20-20と組み合わせたShimadzu Nexera UHPLC、ESIを使用した；カラム：Phenomenex Kinetex 1,7 μm XB-C18 100A；

ESI-MS

移動相：A (水中0.2% ギ酸)：B (メタノール) = 10：90、流速：0.2ml/分、検出：ESI；
陽極

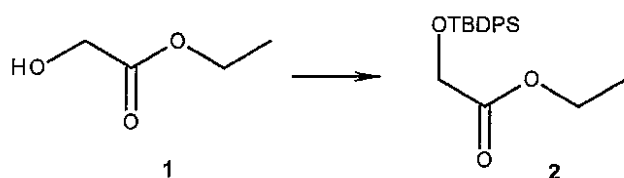
HPLC

カラム：YMC-Pack ODS-AQ、50*4.6mm I.D. S-5 μm、12nm

移動相：A：水(0.025% TFA)、B：メタノール；6.0分

流速：3ml/分、波長：220/254nm、オープン温度：40

【化22】



10

【0202】

化合物2の合成

DCM(ジクロロメタン、2L)中化合物1(200g、1.92mol)の溶液に、TBDPSCl(tert-ブチルジフェニルシリル塩化物、527g、1.92mol)を加え、この混合物を溶解するまで室温で20分間攪拌した。次いで、イミダゾール(261.9g、3.85mol)を20分間かけて少しずつ加えた。得られた混合物を室温で5時間攪拌した。この混合物に飽和NH₄Cl(2L)を加え、水層をDCMで抽出した。合わせた有機物をブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄で乾燥させ、真空中で濃縮した。得られた粗生成物をシリカゲルカラム(石油エーテル：酢酸エチルエステル(ポリエチレン：酢酸エチル = 80:1)で精製し、化合物2(300g、収率47.6%)を得た。

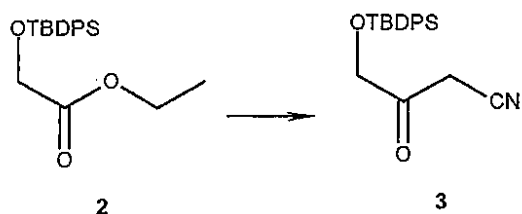
20

【0203】

¹H-NMR (CDCl₃)：δ = 7.68-7.70 (m, 4H), 7.26-7.43 (m, 6H), 4.23 (s, 2H), 4.14 (q, J = 6.8 Hz, 2H), 1.22 (t, J = 6.8 Hz, 3H), 1.09 (s, 9H)。

30

【化23】



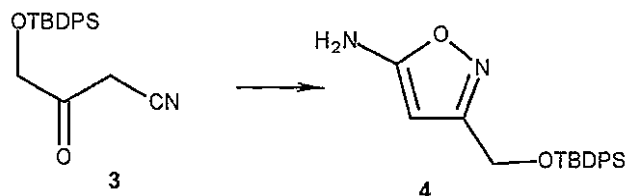
【0204】

化合物3の合成

THF(テトラヒドロフラン)(0.7L)に、-78℃にてN₂下、n-BuLi(2.5M、700mL、1.75mol)を加えた。同じ温度で、THF(300mL)中アセトニトリル(72g、1.75mol)をゆっくりと滴加した。-78℃にて1時間攪拌した後、THF(300mL)中化合物2(300g、0.87mol)の溶液を滴加した。得られた溶液を-78℃から3時間攪拌した。混合物を氷水に注ぎ、pHが5~6になるまで6N HClで酸性化した。THF層を分離し、水層をDCMで抽出した。合わせた有機物を無水Na₂SO₄で乾燥し、真空中で濃縮した。得られた粗生成物(120g)をさらに精製することなく直接使用した。

40

【化 2 4】



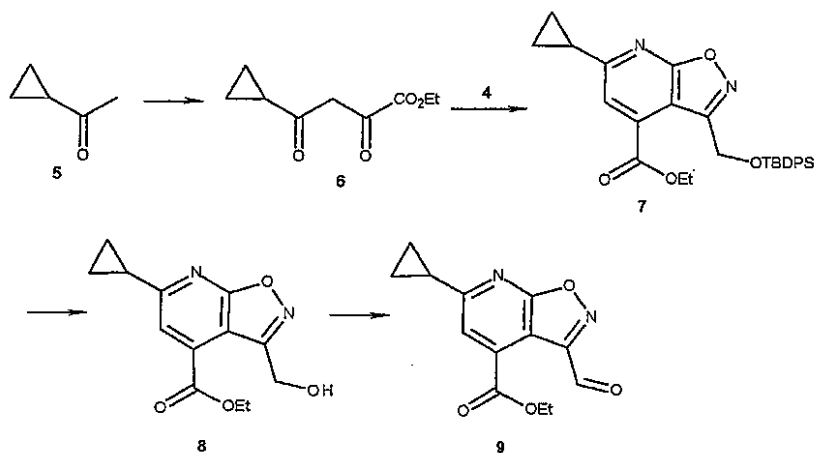
【 0 2 0 5】

化合物4の合成

DCM(2L)中の化合物3(120g、0.35mol)およびNH₂OH-HCl(27.2g、0.39mol)の混合物に、N₂下、NEt₃(トリエタノールアミン、98.5mL、0.71mol)を加えた。混合物を50℃にて12時間攪拌した。次に、これを水に注ぎ入れ、DCMで抽出した。合わせた有機物をブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄で乾燥させ、真空中で濃縮した。得られた粗生成物をシリカゲルカラムで精製し(ポリエチレン:酢酸エチル = 20:1 ~ DCM:メタノール = 80:1)、化合物4(70g、収率55.9%)を得た。

10

【化 2 5】



20

【 0 2 0 6】

化合物6の合成

金属Na(6g、0.26mol)をエタノール(1.5L)に少しずつ加え、溶解するまで攪拌した。上記の溶液を氷水浴中で冷却し、化合物5(20g、0.24mol)を、N₂雰囲気下に滴加した。0.5時間後、シュウ酸ジエチルエステル(31.6g、0.22mol)を、0℃にて強く攪拌しながら滴加した。得られた反応混合物を室温で一晩攪拌した。混合物を水で希釈し、ロータリーエバポレーター(40℃未満の水浴)上で濃縮してエタノールを除去し、残渣を6N水性HClでpH2まで酸性化し、DCMで抽出した。合わせた抽出物をブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄で乾燥させ、ロータリーエバポレーター(30℃未満の水浴)上で濃縮し、化合物6(21g、収率48%)を得た。

30

【 0 2 0 7】

¹H-NMR (CDCl₃): δ = 6.47 (s, 1H), 4.37-4.32 (m, 2H), 1.92-1.86 (m, 1H), 1.37 (t, 3H, J = 7.2 Hz), 1.24-1.04 (m, 4H)。

40

【 0 2 0 8】

化合物7の合成

酢酸(500mL)中の化合物4(70g、0.20mol)および化合物6(36.7g、0.20mol)の溶液を100℃で2時間攪拌した。この混合物を濃縮し、シリカゲルカラム(ポリエチレン:酢酸エチル = 10:1)で精製し、化合物7(97g、収率97%)を得た。

【 0 2 0 9】

化合物8の合成

THF(1.5L)中の化合物7(97g、0.19mol)の溶液に、THF(0.5L)中TBAF(テトラ-n-ブチルアン

50

モニウムフルオリド、62.9g、0.29mol) 溶液を室温で滴加した。得られた混合物を室温で2時間攪拌した。混合物を酢酸エチルで希釈し、ブラインで洗浄した。有機相を無水Na₂SO₄で乾燥させ、真空中で濃縮した。生成物をシリカゲルカラム(PE:酢酸エチル = 1:1)で精製し、化合物8(32.9g、収率64.7%)を得た。

【0210】

¹H-NMR (CDCl₃): δ = 7.79 (s, 1H), 4.99 (s, 2H), 4.52 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 2.25 (m, 1H), 1.48 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.18-1.29 (m, 4H)。

【0211】

化合物9の合成

オキサリルクロリド(28.7g、0.22mol)を、-78℃にてN₂下、DCM(800mL)に加え、次いでDCM(500mL)中DMSO(ジメチルスルホキシド、24g、0.31mol)の溶液を滴加した。この混合物を同じ温度で1時間攪拌し、DCM(500L)中化合物8(32.9g、0.12mol)の溶液を滴加して同じ温度で2時間攪拌した。NEt₃(トリエチルアミン、173.9g、1.25mol)を滴加して反応をクエンチした。有機相をブラインで洗浄し、無水Na₂SO₄で乾燥させ、真空中で濃縮した。得られた粗生成物をシリカゲルカラム(ポリエチレン:酢酸エチル = 3:1)で精製して9(20.7g、収率63%)を得た。

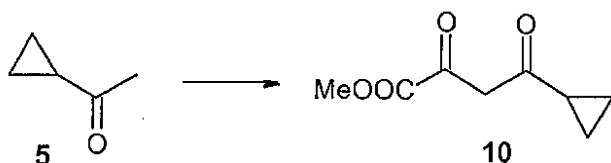
10

【0212】

¹H-NMR (CDCl₃): δ = 10.42 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 4.88 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 2.2-2.3 (m, 1H), 1.40 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.20-1.30 (m, 4H)。

【化26】

20



【0213】

化合物10の合成

ナトリウム(14.67g、0.64mol)を乾燥メタノール(0.8L)に溶解し、乾燥メタノール(0.2L)中シクロプロピルメチルケトン5(50g、0.59mol)およびシュウ酸ジメチル(70.2g、0.59mol)の溶液を0℃にて滴加した。反応混合物を室温で24時間攪拌し、一晚還流した。水(0.5L)を加え、メタノールを減圧下に除去した。この水溶液をEt₂O(150mL)で洗浄し、2M H₂SO₄でpH=2まで酸性化し、Et₂O(ジエチルエーテル、3x150mL)で抽出した。有機層をMgSO₄で乾燥させ、濃縮乾固し、化合物10(55.6g、55%)を得て、これをさらに精製することなく使用した。

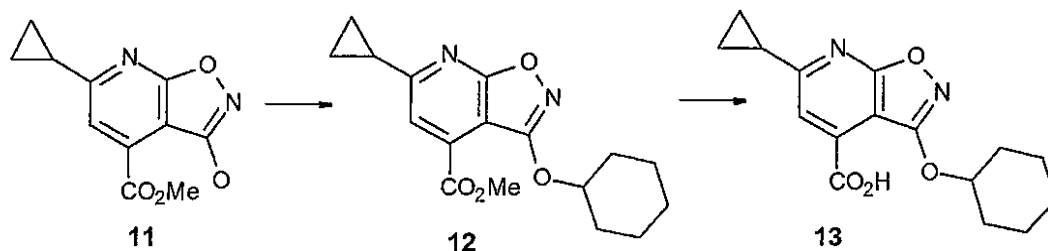
30

【0214】

¹H-NMR (CDCl₃): δ = 14.61 (br, 1H), 6.84 (s, 1H), 3.90 (s, 3H), 1.95-1.82 (m, 1H), 1.26-1.20 (m, 2H), 1.10-1.00 (m, 2H)。

【化27】

40



【0215】

化合物11の合成

酢酸(AcOH)(100mL)中化合物10(17g、0.1mol)および5-アミノ-イソオキサゾール-3-オン(10g、0.1mol)の混合物を還流にて2時間攪拌した。反応混合物を、氷/水(200mL)に注ぎ入れ

50

た。形成された固体を濾過により回収し、高真空下で乾燥させた。19g(82%)の化合物11を得た。

【0216】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): δ = 10.30 (bs, 1H), 7.69 (s, 1H), 4.12 (s, 3H), 2.27-2.20 (m, 1H), 1.29-1.22 (m, 2H), 1.21-1.12 (m, 2H); MS: m/z = 235 $[\text{M}+\text{H}]^+$

【0217】

化合物12の合成

乾燥THF(5mL)中トリフェニルホスフィン(370mg、1.4mmol)の攪拌溶液に、0℃にて窒素雰囲気下、ジイソプロピルアゾジカルボキシレート(280mg、1.4mmol)を滴加し、混合物を20分間攪拌した。次いで、シクロヘキサノール(130mg、1.3mmol)および化合物11(300mg、1.3mmol)を0℃にて加えた。混合物を室温で2時間攪拌し、40℃まで加熱し、一晚攪拌した。混合物を室温まで冷却し、トリフェニルホスフィン(370mg、1.4mmol)、シクロヘキサノール(130mg、1.3mmol)およびジイソプロピルアゾジカルボキシレート(280mg、1.4mmol)をさらに1回加えた。この混合物を室温で1時間攪拌し、60℃まで加熱し、一晚攪拌した。溶媒を減圧下に除去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(SiO_2 、c-ヘキサン/酢酸エチル)で精製し、化合物12(320mg、収率78%)を得た。

10

【0218】

化合物13の合成

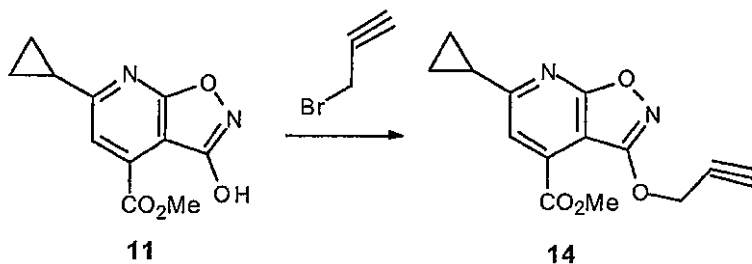
1:1 THF/1N NaOH(5mL)混合物中の化合物12(285mg、0.9mmol)の溶液を室温で1.5時間攪拌した。反応物を真空中で濃縮し、水溶液を10% HClでpH2まで酸性化し、形成された固体を濾過により回収し、高真空下で乾燥させて化合物13(250mg、92%)を得た。

20

【0219】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): δ = 7.84 (s, 1H); 5.08-5.15 (m, 1H); 2.11-2.27 (m, 3H); 1.71-1.82 (m, 4H); 1.35-1.68 (m, 4H); 1.18-1.31 (m, 4H);

【化28】



30

【0220】

化合物14の合成

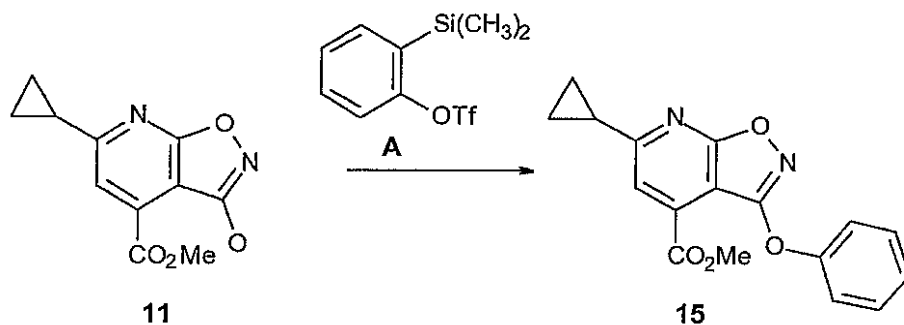
乾燥DMF(ジメチルホルムアミド、100mL)中の化合物11(5.0g、0.02mol)および K_2CO_3 (5.9g、0.03mol)の攪拌溶液に、室温にて窒素雰囲気下、プロパルギルプロミド(3.6g、0.03mol)を滴加し、混合物を2時間攪拌した。この溶媒を真空中で除去し、残渣を酢酸エチルと水との間で分配した。有機層をブラインで洗浄し、無水 Na_2SO_4 で乾燥させ、真空中で濃縮した。得られた粗生成物をシリカゲルカラム(c-ヘキサン: 酢酸エチル = 10:1)で精製し、14(2.5 g、収率43%)を得た。

40

【0221】

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO): σ = 7.65 (s, 1H); 5.09 (s, 2H); 4.50 (q, 2H); 2.61 (s, 1H); 2.25-2.15 (m, 1H); 1.46 (t, 3H); 1.10-1.30 (m, 4H); LCMS: 1.196 分、 m/z = 287 $[\text{M}+\text{H}]^+$

【化 2 9】



10

【 0 2 2 2】

化合物15の合成

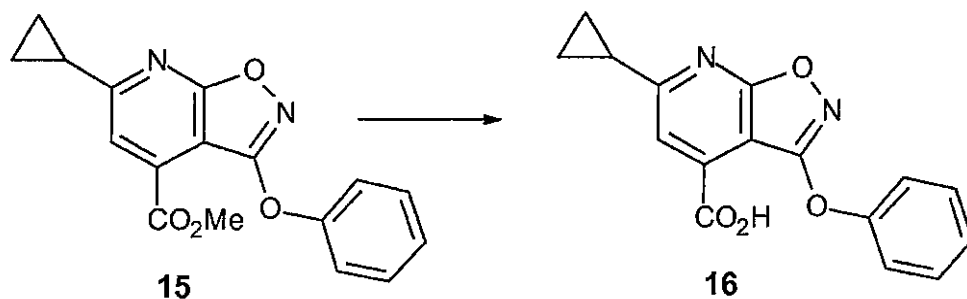
アセトニトリル(80mL)、化合物11(1.0g、0.004mol)およびシリルアールトリフラートA(2.0g、0.006mol)の溶液に、CsF(2.0g、0.014mol)を加えた。反応混合物を室温で24時間攪拌し、得られた溶液をブライン(20mL)で洗浄し、酢酸エチル(20mL)で抽出した。合わせたエーテル画分を Na_2SO_4 で乾燥させ、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲル上のフラッシュクロマトグラフィーで精製し、所望の生成物15(0.9g、収率67%)を得た。

【 0 2 2 3】

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO): σ = 7.78-7.80 (d, J = 8.01Hz, 2H); 7.76(s, 1H); 7.54 (t, J =8.0 Hz, 2H); 7.34 (t, J = 8.0 Hz, 1H); 3.34(s, 3H); 2.41-2.46 (m, 1H); 1.11-1.24 (m, 4H); LCMS: 3.608 分、 m/z = 311 $[\text{M}+\text{H}]^+$

20

【化 3 0】



30

【 0 2 2 4】

化合物16の合成

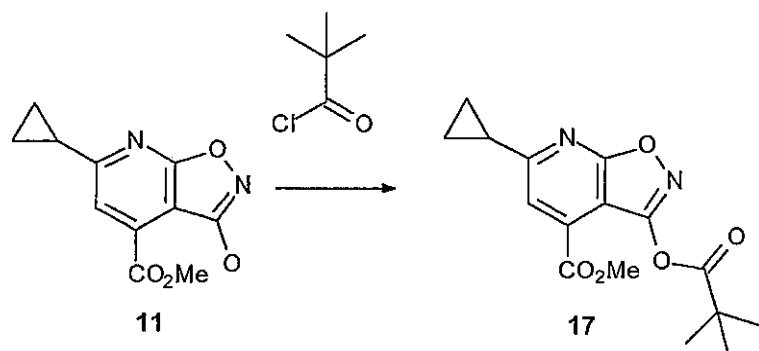
混合物1:1 THF/ H_2O (20mL)中の化合物15(0.9g、0.003mol)の溶液に、水(5mL)中水酸化リチウム(0.3g、0.012mol)の溶液を加えた。反応混合物を室温で1.5時間攪拌した。反応物を真空中で濃縮し、この水溶液を10% HClでpH2まで酸性化し、形成された固体を濾過により回収し、高真空下で乾燥させて化合物16(0.3g、33%)を得た。

【 0 2 2 5】

$^1\text{H-NMR}$ (CD_3) $_2\text{CO}$: σ = 7.99 (s, 1H); 7.93-7.95 (m, 2H); 7.63 (t, 2H); 7.47 (t, 1H); 2.50-2.60 (m, 1H); 1.22-1.33 (m, 4H)。

40

【化 3 1】



10

【 0 2 2 6】

化合物17の合成

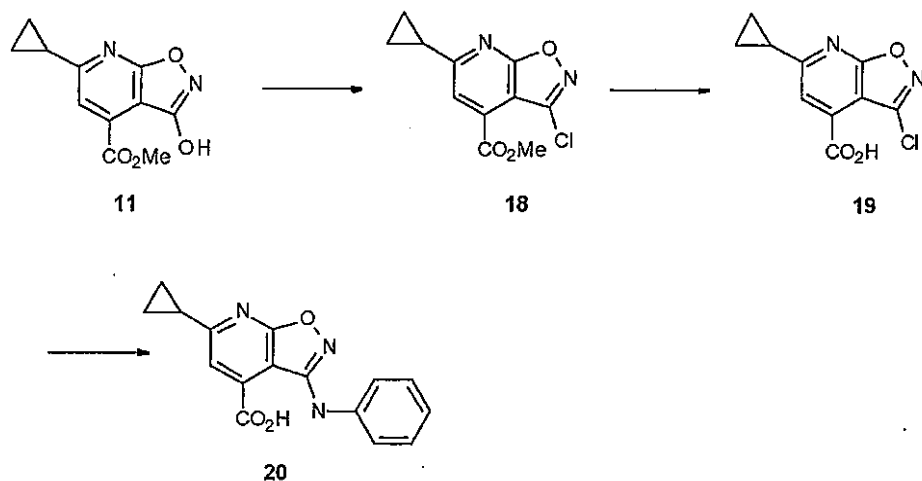
乾燥DCM(20mL)中の化合物11(1.0g、0.004mol)およびNEt₃(0.6g、0.006mol)の攪拌溶液に、0℃にて窒素雰囲気下、ピバル酸塩化物(3.6g、0.004mol)を滴加した。反応混合物を室温にて2時間攪拌した。溶媒を真空中で除去し、残渣を酢酸エチルと水との間で分配した。有機層を5% HClと水の水溶液で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、真空中で濃縮して17(1.2g、収率88%)を得た。

【 0 2 2 7】

¹H-NMR (DMSO): σ = 7.70 (s, 1H); 3.94 (s, 3H); 2.26-2.16 (m, 1H); 1.45 (s, 9H); 1.30-1.16 (m, 4H); LCMS: 3.868 分、m/z = 235 [M-tBuCO+H]⁺

20

【化 3 2】



30

【 0 2 2 8】

化合物18の合成

化合物11(12.0g、0.05mol)、ピリジン塩酸塩(20.0g、0.17mol)、H₃PO₄(3.6g、0.04mol)およびPOCl₃(120mL)の混合物を90℃で3時間攪拌した。過剰のPOCl₃を高真空下に蒸発させた。残りの混合物を酢酸エチルに溶解し、0℃にてNaHCO₃でゆっくりと中和した。有機層をブラインと水で洗浄し、MgSO₄で乾燥させ、濃縮乾固した。残渣をカラムクロマトグラフィー(SiO₂、c-ヘキサン/酢酸エチル)で精製し、化合物18(6.5 g、収率50%)を得た。

40

【 0 2 2 9】

¹H-NMR (CDCl₃): δ = 7.72 (s, 1H), 4.05 (s, 3H), 2.29-2.20 (m, 1H), 1.32-1.26 (m, 2H), 1.25-1.18 (m, 2H); MS: m/z = 253 [M+H]⁺

【 0 2 3 0】

化合物19の合成

混合物1:1THF/水(100mL)中の化合物18(9.3g、0.035mol)の溶液に、水(15mL)中水酸化リチウム(1.0g、0.041mol)の溶液を加えた。反応混合物を室温で1.5時間攪拌した。反応物を真空中で濃縮し、水溶液を10% HClでpH2まで酸性化し、形成された固体を濾過により回収

50

し、高真空下で乾燥させて化合物19(8.3g、99%)を得た。

【0231】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 9.50-9.70$ (bs, 1H), 7.61 (s, 1H) 2.85 (s, 3H), 2.28-2.19 (m, 1H), 1.30-1.10 (m, 2H); LCMS: 1.099分、 $m/z = 239$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

【0232】

化合物20の合成

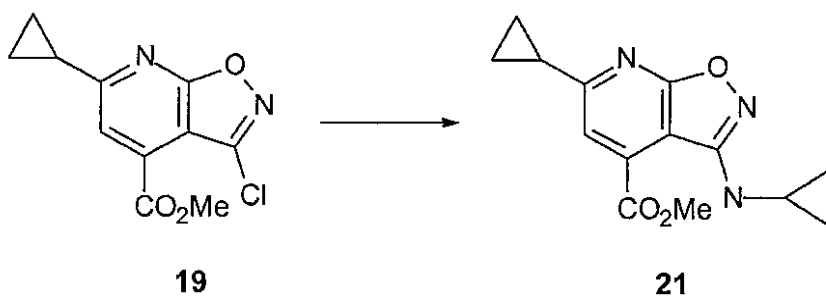
化合物19(500mg、2.1mmol)およびアニリン(5mL)を、マイクロ波中で10パル、120 にて1時間攪拌した。反応物を真空中で濃縮し、残渣をジイソプロピルエーテルに溶解した。形成された固体を濾過により回収し、高真空下で乾燥させて化合物20(300mg、48%)を得た。

10

【0233】

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO): $\delta = 23.35$ (s, 1H); 11.9 (bs, 1H) 7.69 (s, 1H); 7.56-7.50 (m, 2H); 7.35 (t, 2H); 6.93 (t, 1H); 2.35-2.26 (m, 1H); 1.00-1.10 (m, 4H); LCMS: 1.335分、 $m/z = 296$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

【化33】



20

【0234】

化合物21の合成

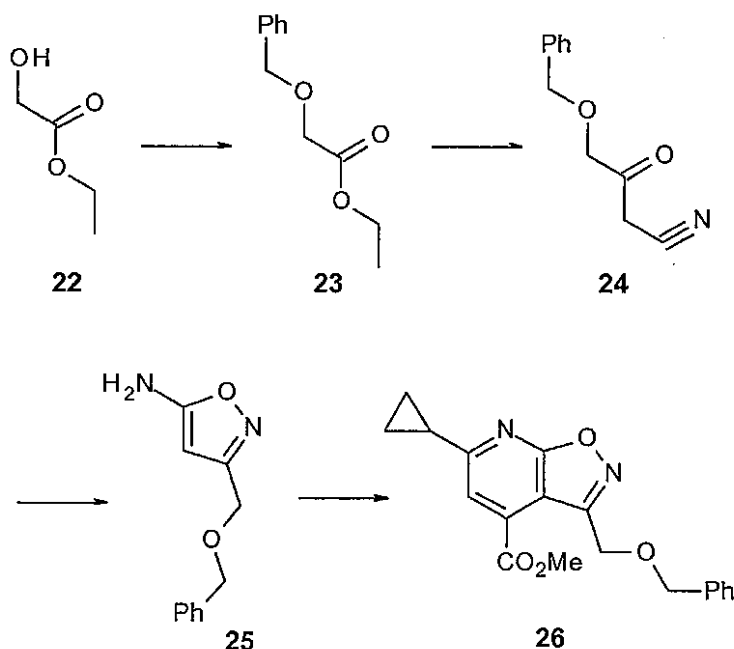
化合物19(500mg、2.1mmol)およびシクロプロピルアミン(5mL)を、マイクロ波中で5パル、120 にて1時間攪拌した。反応物を真空中で濃縮し、調製HPLCで精製し、化合物21(65mg、12%)を得た。

【0235】

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO): $\delta = 7.75$ (s, 1H); 7.28 (s, 1H); 2.70-2.58 (m, 1H); 2.42-2.35 (m, 1H); 1.18-1.00 (m, 4H); 0.80-0.70 (m, 2H); 0.51-0.59 (m, 2H); LCMS: 2.489分、 $m/z = 260$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

30

【化 3 4】



10

【 0 2 3 6】

20

化合物23の合成

THF(1.5L)中のヒドロキシ-酢酸エチルエステル22(99.6g、0.96mol)の溶液に、窒素雰囲気下、NaH(42.0g、1.0mol：鉱油中60%)を0℃にて少しずつ加えた。この混合物を0℃で30分間攪拌し、テトラブチルアンモニウムヨード(35.3g、0.10mol)とベンジルブロミド(163.6g、0.96mol)を加えた。混合物を室温まで温め、この温度で12時間攪拌した。反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機層をMgSO₄で乾燥させ、溶媒を高真空下に蒸発させ、粗生成物を蒸留し(121℃/4mBar)、化合物23(135.5g、収率73%)を得た。

【 0 2 3 7】

¹H-NMR (CDCl₃): δ = 7.41- 7.22 (m, 5H), 4.65 (s, 2H), 4.27 (q, 2H), 4.11 (s, 2H), 1.25 (t, 3H)。

30

【 0 2 3 8】

化合物24の合成

テトラヒドロフラン(1L)およびNaH(30.0g、0.77mol：鉱油中60%)を窒素雰囲気下に攪拌し、50℃まで加熱した。この混合物に、化合物23(135.5g、0.70mol)およびアセトニトリル(37.1g、0.90mol)のテトラヒドロフラン溶液を加えた。反応物を室温で12時間攪拌した。反応混合物を水で希釈し、MTBE(メチルtert-ブチルエーテル)で抽出した。水相をクエン酸(pH=3)で酸性化し、酢酸エチルで抽出した。有機層をブラインおよび水で洗浄し、MgSO₄で乾燥させて濃縮乾固した。残渣をカラムクロマトグラフィー(SiO₂、c-ヘキサン/酢酸エチル)で精製し、化合物24(41g、収率31%)を得た。

【 0 2 3 9】

¹H-NMR (CDCl₃): δ = 7.40- 7.21 (m, 5H), 4.58 (s, 2H), 4.10 (s, 2H), 3.61 (s, 2H)。

40

【 0 2 4 0】

化合物25の合成

エタノール(1L)中の化合物24(63.3g、0.33mol)、ヒドロキシルアミン塩酸塩(30.2g、0.43mol)および酢酸ナトリウム(82.3g、1mol)の混合物を、室温で4時間攪拌した。溶媒を高真空下で除去した。反応混合物を水に注ぎ入れ、メチレンクロリドで抽出した。有機層をブラインおよび水で洗浄し、MgSO₄で乾燥させて濃縮乾固した。残渣をカラムクロマトグラフィー(SiO₂、c-ヘキサン/酢酸エチル)で精製し、化合物25(13.8g、収率20%)を得た。

【 0 2 4 1】

50

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 7.40\text{--}7.22$ (m, 5H), 5.20 (s, 1H), 4.55 (bs, 4H), 4.46 (s, 2H)。

【0242】

化合物26の合成

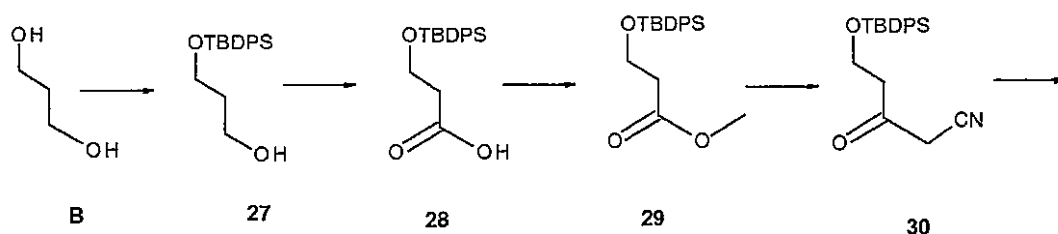
酢酸(150mL)中の化合物10(11.5g、0.07mol)および化合物25(13.8g、0.07mol)の混合物を、還流で2時間攪拌した。反応混合物を氷/水(200mL)に注ぎ入れた。形成された固体を濾過により回収し、高真空下で乾燥させた。化合物26(16.5 g、72%)を得た。

【0243】

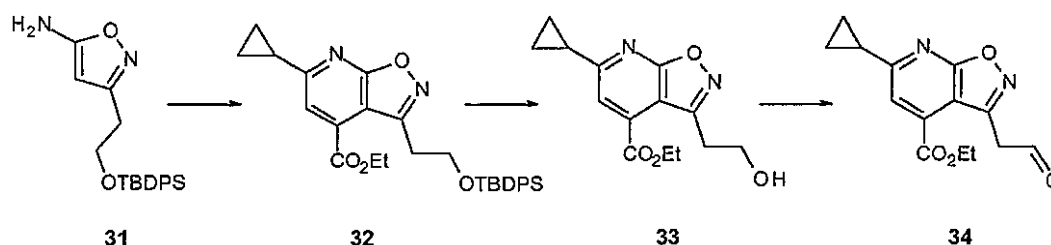
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 7.68$ (s, 1H), 7.32 (s, 5H), 5.03 (s, 2H), 4.60 (s, 2H), 3.95 (s, 3H), 2.26-2.20 (m, 1H), 1.30-1.25 (m, 2H), 1.20-1.12 (m, 2H); MS: $m/z = 339$ [M+H]⁺

10

【化35】



20



【0244】

化合物27の合成

乾燥DCM(3L)中のプロパン-1,3-ジオールB(304g、4mol)の溶液に、 Et_3N (1212g、12mol)およびTBDPSCl(548g、2 mol)を加え、この混合物を20℃で16時間攪拌した。混合物をブラインで洗浄し、乾燥させ、濃縮し、シリカゲルカラム(ポリエチレン:酢酸エチル = 1000:1)で精製して、生成物として化合物27(300g、収率47.8%)を得た。

30

【0245】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 7.66\text{--}7.68$ (m, 4H), 7.39-7.43 (m, 6H), 3.82-3.85 (m, 4H), 1.80-1.81 (m, 2H), 1.04 (s, 9H)。

【0246】

化合物28の合成

乾燥アセトン(3L)中の化合物27(278g、0.88mol)の溶液に、ジョーンズ試薬(濃 H_2SO_4 (128mL)および水(557mL)中の CrO_3 (148.7g))を0℃にて滴加し、0℃で16時間攪拌した。溶媒は真空中で除去し、残渣を酢酸エチルと水との間で分配した。有機層をブラインで洗浄し、乾燥させて濃縮し、生成物として化合物28(289g、87.8%)を得た。

40

【0247】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 7.66\text{--}7.68$ (m, 4H), 7.38-7.43 (m, 6H), 3.94 (t, $J=6.8$ Hz, 2H), 2.60 (t, $J=6.8$ Hz, 2H), 1.04 (s, 9H)。

【0248】

化合物29の合成

乾燥DMF(2 L)中の化合物28(180g、0.549mol)の溶液に、 K_2CO_3 (151.8g、1.098mol)、次いで CH_3I (90.5g、0.604mol)を添加した。この混合物を20℃にて16時間攪拌した。溶媒を除去し、残渣をシリカゲルカラム(ポリエチレン:酢酸エチル= 100:1)で精製し、化合物29(1

50

70g、収率90.6%)を得た。

【0249】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 7.65\text{--}7.68$ (m, 4H), $7.38\text{--}7.43$ (m, 6H), 3.95 (t, $J=6.8$ Hz, 2H), 3.68 (s, 3H), 2.61 (t, $J=6.8$ Hz, 2H), 1.03 (s, 9H)。

【0250】

化合物30の合成

THF(3L)中の $n\text{-BuLi}$ (487mL、1.264mol)の溶液に、 -78°C にて N_2 下、THF(100mL)中の CH_3CN (50g、1.264mol)を滴加し、2時間攪拌した。次いで化合物29(300g、0.843mol)をゆっくりと加え、混合物を -78°C ~ 20°C にて5時間攪拌した。混合物を氷-水に注ぎ入れ、6N水性HClでpH3まで酸性化し、酢酸エチルで抽出した。有機層をシリカゲルカラム(ポリエチレン:酢酸エチル=100:1)で精製し、化合物30(200g、収率64.9%)を得た。

10

【0251】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 7.62\text{--}7.72$ (m, 4H), $7.37\text{--}7.45$ (m, 6H), 3.95 (t, $J=6.8$ Hz, 2H), 3.53 (s, 3H), 2.75 (t, $J=6.8$ Hz, 2H), 1.04 (s, 9H)。

【0252】

化合物31の合成

DCM(2L)中の化合物30(170g、0.484mol)および $\text{NH}_2\text{OH}\cdot\text{HCl}$ (34.4g、0.484mol)の混合物に、 Et_3N (73.3g、0.726mol)を0 $^\circ\text{C}$ にて滴加し、混合物を還流で5時間加熱した。混合物をブラインで洗浄し、乾燥させて濃縮し、化合物31(120g、収率70.6%)を得た。

【0253】

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 7.62\text{--}7.72$ (m, 4H), $7.37\text{--}7.45$ (m, 6H), 3.95 (t, $J=6.8$ Hz, 2H), 3.53 (s, 3H), 2.75 (t, $J=6.8$ Hz, 2H), 1.04 (s, 9H)。

【0254】

化合物32の合成

酢酸(1500mL)中の化合物31(120g、0.328mol)の溶液に、化合物6(60.3g、0.328mol)を20 $^\circ\text{C}$ にて滴加し、混合物を還流で5時間加熱した。溶媒を除去し、残渣を酢酸エチルと水との間で分配した。合わせた有機物をブラインで洗浄し、乾燥させて濃縮し、化合物32(170g、収率100%)を得た。

【0255】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 7.62$ (s, 1H), $7.28\text{--}7.55$ (m, 10H), 4.38 (q, 2H), 4.05 (t, $J=6.8$ Hz, 2H), 3.45 (t, $J=6.8$ Hz, 2H), 2.22 (m, 1H), 1.38 (m, 3H), $1.15\text{--}1.28$ (m, 4H), 0.99 (s, 9H)。

30

【0256】

化合物33の合成

THF(2L)中の化合物32(170g、0.331mol)の溶液に、THF(300mL)中のTBAF(129.5g、0.496mol)の溶液を滴加し、混合物を20 $^\circ\text{C}$ にて15時間攪拌した。溶媒を除去し、残渣をシリカゲルカラム(ポリエチレン:酢酸エチル = 10:1)で精製し、化合物33(78g、収率85.7%)を得た。

【0257】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 7.68$ (s, 1H), 4.46 (q, $J=7.2$ Hz, 2H), 4.10 (t, $J=7.2$ Hz, 2H), 3.41 (t, $J=6.4$ Hz, 2H), 2.32 (m, 1H), 1.45 (t, $J=7.2$ Hz, 3H), $1.22\text{--}1.26$ (m, 4H)。

40

【0258】

化合物34の合成

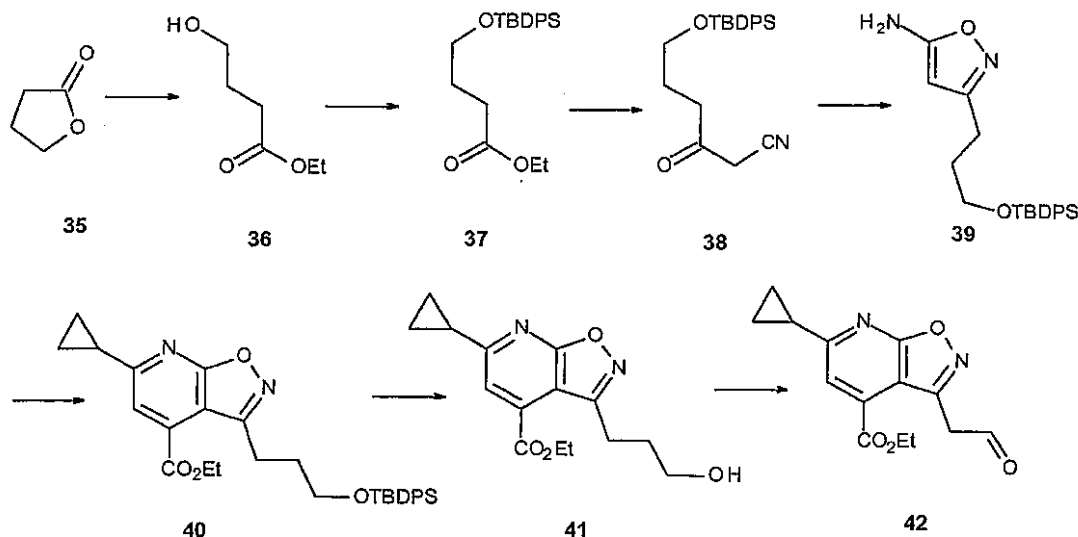
DCM(2L)中の化合物33(45g、0.163mol)の溶液に、Dess-Martinペリオジナン(103.6g、0.244mol)を加え、混合物を20 $^\circ\text{C}$ にて15時間攪拌した。溶媒を除去し、残渣をシリカゲルカラム(ポリエチレン:酢酸エチル = 5:1)で精製して、生成物34(38g、83.0%)を得た。

【0259】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 9.87$ (s, 1H), 7.72 (s, 1H), 4.41 (q, $J=7.2$ Hz, 2H), 3.45 (s, 1H), 2.23 (m, 1H), 1.40 (t, $J=7.2$ Hz, 3H), $1.16\text{--}1.28$ (m, 4H)。

50

【化 3 6】



10

【 0 2 6 0】

化合物36の合成

エタノール(3L)中の化合物35(258g、3mol)およびナトリウムエトキシド(16.2g、0.3mol)の混合物を、20℃にて48時間攪拌した。この混合物を濃縮し、残渣をDCMで処理し、固体を濾別した。濾液を乾燥させて濃縮し、粗生成物として化合物36(150g、21.4%)を得た。

20

【 0 2 6 1】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 4.11$ (q, $J=7.2$ Hz, 2H), 3.62 (m, 2H), 2.48 (m, 2H), 1.81 - 1.86 (m, 2H), 1.17 (t, $J=7.2$ Hz, 3H)。

【 0 2 6 2】

化合物37の合成

DCM(1.5L)中の化合物36(132g、1mol)の溶液に、イミダゾール(81.6g、1.2mol)、次いでTBPDPSiCl(274g、1mol)を滴加した。この混合物を20℃にて16時間攪拌した。混合物を濃縮し、残渣をシリカゲルカラム(ポリエチレン:酢酸エチル= 500:1)で精製し、生成物として化合物37(300g、収率81.1%)を得た。

30

【 0 2 6 3】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 7.36$ - 7.73 (m, 10H), 4.11 (q, $J=7.2$ Hz, 2H), 3.69 (t, $J=6.4$ Hz, 2H), 2.45 (t, $J=7.6$ Hz, 2H), 1.85 - 1.92 (m, 2H), 1.24 (t, $J=7.2$ Hz, 3H), 0.87 (s, 9H)。

【 0 2 6 4】

化合物38の合成

THF(3L)中のn-BuLi(487mL、1.216mol)の溶液に、 -78°C にて N_2 下、THF(100mL)中の CH_3CN (50g、1.216mol)を滴加し、2時間攪拌した。次いで、化合物37(300g、0.811mol)をゆっくりと加え、 -78°C ~ 20°C にて5時間攪拌した。この混合物を水に注ぎ入れ、6N水性HClでpH 3まで酸性化し、酢酸エチルで抽出した。有機層をシリカゲルカラム(ポリエチレン:酢酸エチル=100:1)で精製し、生成物として化合物38(250g、収率84.5%)を得た。

40

【 0 2 6 5】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): $\delta = 7.39$ - 7.74 (m, 10H), 3.70 (t, $J=6.0$ Hz, 2H), 3.39 (s, 2H), 2.71 (t, $J=7.2$ Hz, 2H), 1.85 - 1.90 (m, 2H), 1.24 (t, $J=7.2$ Hz, 3H), 1.07 (s, 9H)。

【 0 2 6 6】

化合物39の合成

DCM(2L)中の化合物38(190g、0.52mol)および $\text{NH}_2\text{OH}\cdot\text{HCl}$ (55.4g、0.78mol)の混合物に、 Et_3N (78.9g、0.78mol)を0℃にて滴加し、混合物を還流で5時間加熱した。混合物をブラインで洗浄し、乾燥させて濃縮し生成物として化合物39(185g、収率93.6%)を得た。

50

【 0 2 6 7 】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): δ =7.65-7.67 (m, 4H), 7.36-7.44 (m, 6H), 4.92 (s, 1H), 3.72 (t, J =6.4 Hz, 2H), 2.63 (t, J =7.6 Hz, 2H), 1.04 (s, 9H)。

【 0 2 6 8 】

化合物40の合成

酢酸(1L)中の化合物39(190g、0.50mol)の溶液に、化合物6(92g、0.50mol)を20℃にて滴加し、混合物を還流で5時間加熱した。溶媒を除去し、残渣を酢酸エチルと水で処理した。合わせた有機物をブラインで洗浄し、乾燥させて濃縮し、生成物として化合物40(200g、収率75.8%)を得た。

【 0 2 6 9 】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): δ =7.64-7.66 (m, 4H), 7.32-7.39 (m, 6H), 4.43 (q, J =7.2 Hz, 2H), 3.79 (t, J =6.4 Hz, 2H), 3.25 (t, J =7.2 Hz, 2H), 2.22 (m, 1H), 2.04 (m, 1H), 1.43 (t, 3H), 1.15-1.28 (m, 4H), 1.14-1.17 (m, 4H), 1.07 (s, 9H)。

【 0 2 7 0 】

化合物41の合成

THF(2L)中の化合物40(200g、0.379mol)の溶液に、THF(300mL)中のTBAF(148.3g、0.568mol)を滴加し、混合物を20℃にて15時間攪拌した。溶媒を除去し、残渣をシリカゲルカラム(ポリエチレン:酢酸エチル=5:1)で精製し、生成物として化合物41(50g、収率45.5%)を得た。

【 0 2 7 1 】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): δ =7.68 (s, 1H), 4.48 (q, J =7.2 Hz, 2H), 3.75 (t, J =6.0 Hz, 2H), 3.27 (t, J =7.2 Hz, 2H), 2.21 (m, 1H), 2.06 (m, 2H), 1.46 (t, J =7.2 Hz, 3H), 1.14-1.27 (m, 4H)。

【 0 2 7 2 】

化合物42の合成

DCM(1L)中のオキサリルクロリド(43.8g、0.344mol)の溶液に、-78℃にて N_2 下、DMSO(26.9g、0.344mol)を滴加し、1時間攪拌した。次いで、DCM(100mL)中の化合物41(50g、0.172mol)を-78℃にて滴加し、2時間攪拌した。次いで、 Et_3N (173.7g、1.72mol)を滴加し、-78℃~20℃にて2時間攪拌した。混合物を飽和 NH_4Cl でクエンチし、有機層をブラインで洗浄し、シリカゲルカラム(ポリエチレン:酢酸エチル=5:1)で精製して生成物42(14.3g、収率28.9%)を得た。

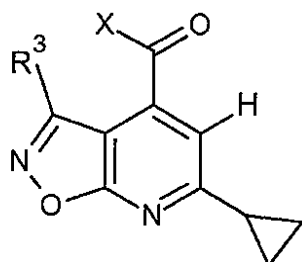
【 0 2 7 3 】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): δ =9.92 (s, 1H), 7.71 (s, 1H), 4.48 (q, J =7.2 Hz, 2H), 3.48 (t, J =7.2 Hz, 2H), 3.06 (t, J =7.2 Hz, 2H), 2.24 (m, 1H), 1.47 (t, J =7.2 Hz, 3H), 1.16-1.27(m, 4H)。

【 0 2 7 4 】

以下の表3に記載されるイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンを、上記の方法に従って調製した。

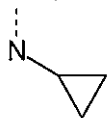
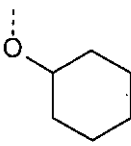
【化 3 7】

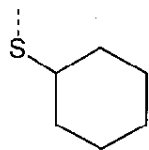
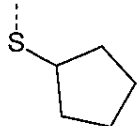
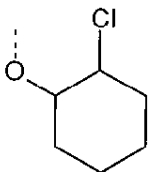
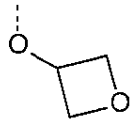
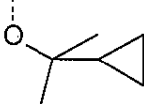
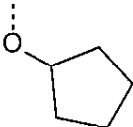


1a

【表 2】

表 3:

化合物 no	R ³	X	保持時間(分)	m/z=[M+H] ⁺	融点(°C)
I.a.41.	-O(CO)C(CH ₃) ₃ 本発明によるものではない実施例	-OCH ₃	3.861	235 [M-tBuCO+H] ⁺	58
I.a.42.	-O(CO)C(CH ₃) ₃ 本発明によるものではない実施例	-OH	1.843	221 [M-tBuCO+H] ⁺	246
I.a.43.	-O(CO)C ₆ H ₅	-OCH ₃	4.004	339	127
I.a.44.	-OCH ₂ CHCH ₂	-OH	1.095	261	153
I.a.45.	-OCH ₂ OCH ₃	-OH	0.999	265	147
I.a.46.	-OC ₆ H ₅	-OH			223
I.a.47.	-CHNOH	-OCH ₃	0.988	262	
I.a.48.	-CHNNH(CO)NHCH ₂ CF ₃	-OCH ₃	1.085	386	
I.a.49.	-CHNNH(CO)NHCH ₂ CH ₃	-OCH ₃	1.029	332	
I.a.50.	-CHNNH(CO)NHCH ₂ CF ₃	-OH	0.980	372	
I.a.51.	-CHNNH(CO)NHCH ₂ CH ₃	-OH	0.905	318	
I.a.52.	-CHNOCH ₃	-OCH ₃	1.157	276	
I.a.53.	-CH ₂ O(CO)CH ₃	-OH	2.686	277	220
I.a.54.	-CHNOH	-OH	0.839	248	
I.a.55.	-CHNOCH ₃	-OH	0.963	262	
I.a.56.	-NHC ₆ H ₅	-OH	3.349	296	50.5
I.a.57.	-NHC ₆ H ₅	-SCH ₃	4.183	326	192
I.a.58.		-OH	2.500	260	
I.a.59.	-(CH ₂) ₂ CHNOCH ₃	-OH	2.825	290	
I.a.60.	-(CH ₂) ₂ CHNNH(CO)NHCH ₂ CF ₃	-OH	2.856	400	
I.a.61.	-(CH ₂) ₂ CHNNH(CO)NHCH ₂ CH ₃	-OH	2.570	346	
I.a.62.	-(CH ₂) ₂ (CO)CH ₂ CH ₃	-OH	2.708	289	120
I.a.63.	-CH ₂ CHNOCH ₃	-OH	2.743	276	
I.a.64.	-CH ₂ CHNOH	-OH	0.846	262	
I.a.65.		-OH			
I.a.66.	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-OH	1.179	311	
I.a.67.	-O(CH ₂) ₂ OCH ₃	-OH	0.970	279	
I.a.68.	-CHO	-OCH ₂ CH ₃			
I.a.69.	-CH ₂ CHO	-OCH ₂ CH ₃			
I.a.70.	-(CH ₂) ₂ CHO	-OCH ₂ CH ₃			
I.a.71.	-OCH ₂ CCH	-OCH ₂ CH ₃	1.196	287	
I.a.72.	-(CH ₂) ₂ C(CH ₂ CH ₃)NOCH ₃	-OCH ₂ CH ₃	1.348, 1.385 (E/Z)	346	
I.a.73.	-(CH ₂) ₂ C(CH ₂ CH ₃)NOH	-OCH ₂ CH ₃	1.173, 1.197 (E/Z)	332	
I.a.74.	-(CH ₂) ₂ (CO)CH ₂ CH ₃	-OH	1.014	289	
I.a.75.	-CH ₂ C(CH ₂ CH ₃)NOH	-OH	0.925	290	
I.a.76.	-CH ₂ C(CH ₂ CH ₃)NOH	-OCH ₂ CH ₃	1.121	318	

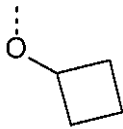
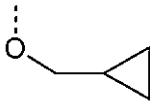
化合物 no	R ³	X	保持時間 (分)	m/z=[M+H] ⁺	融点 (°C)
I.a.77.	-CH ₂ (CO)CH ₂ CH ₃	-OCH ₂ CH ₃	1.215	303	
I.a.78.	-CH ₂ (CO)CH ₂ CH ₃	-OH	0.682	275	
I.a.79.	-(CH ₂) ₂ C(CH ₂ CH ₃)NCH (E/Z 混合物として)	-OH	0.952 および 0.981	304	201
I.a.80.	-(CH ₂) ₂ C(CH ₂ CH ₃)NOCH ₃ (E/Z 混合物として)	-OH	1.092 および 1.129	318	154
I.a.81.	-(CH ₂) ₂ C(CH ₂ CH ₃)NNH ₂	-OH	0.961	303	116
I.a.82.	-OCH ₂ CCH	-OH			186
I.a.83.	-S-(4-CF ₃ -C ₆ H ₄)	-OH	3.780	381	222
I.a.84.	-SC ₆ H ₅	-OH	1.127	313	195
I.a.85.	-SCH ₂ C ₆ H ₅	-OH	1.196	327	163
I.a.86.		-OH	1.275	319	148
I.a.87.		-OH	1.210	305	143
I.a.88.		-OH	1.148	337	136
I.a.89.		-OH	0.884	277	128
I.a.90.		-OH			181
I.a.91.		-OH	1.118	289	145

10

20

30

40

化合物 no	R ³	X	保持時間(分)	m/z=[M+H] ⁺	融点(°C)
I.a.92.		-OH	1.059	275	158
I.a.93.		-OH	1.051	275	151

10

化合物 no	¹ H NMR
I. a. 46	(CD ₃) ₂ CO: σ = 7.99 (s, 1H); 7.93–7.95 (m, 2H); 7.63 (t, 2H); 7.47 (t, 1H); 2.50–2.60 (m, 1H); 1.22–1.33 (m, 4H);
I. a. 65	CDCl ₃ : σ = 7.84 (s, 1H); 5.08–5.15 (m, 1H); 2.11–2.27 (m, 3H); 1.71–1.82 (m, 4H); 1.35–1.68 (m, 4H); 1.18–1.31 (m, 4H)
I. a. 68	CDCl ₃ : δ = 10.42 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 4.88 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 2.2~2.3 (m, 1H), 1.40 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.20~1.30 (m, 4H)
I. a. 69	CDCl ₃ : δ = 9.87 (s, 1H), 7.72 (s, 1H), 4.41 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 3.45 (s, 1H), 2.23 (m, 1H), 1.40 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.16~1.28 (m, 4H)
I. a. 70	CDCl ₃ : δ = 9.92 (s, 1H), 7.71 (s, 1H), 4.48 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 3.48 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 3.06 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.24 (m, 1H), 1.47 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.16~1.27 (m, 4H).
I. a. 82	(CD ₃)Cl ₃ : σ = 7.79 (s, 1H); 5.13 (s, 2H); 2.66 (s, 1H); 2.20–2.30 (m, 1H); 1.17–1.36 (m, 4H);
I. a. 84	(CD ₃) ₂ SO: σ = 7.85 (s, 1H); 7.64–7.73 (m, 2H); 7.43–7.52 (m, 3H); 2.40–2.55 (m, 1H); 1.00–1.25 (m, 4H);
I. a. 87	(CD ₃) ₂ SO: σ = 7.79 (s, 1H); 3.91 (quintet, 1H); 2.40–2.50 (m, 1H); 2.18–2.30 (m, 2H); 1.55–1.80 (m, 6H); 1.08–1.21 (m, 4H);
I. a. 89	(CD ₃)Cl ₃ : σ = 7.75 (s, 1H); 5.68 (t, 1H); 5.05–5.16 (m, 2H); 4.86–4.93 (m, 2H); 2.21–2.30 (m, 1H); 1.18–1.35 (m, 4H);
I. a. 90	(CD ₃)Cl ₃ : σ = 7.90 (s, 1H); 2.25–2.32 (m, 1H); 1.63 (s, 6H); 1.49–1.60 (m, 1H); 1.21–1.30 (m, 4H); 0.50–0.62 (m, 4H);
I. a. 92	(CD ₃)Cl ₃ : σ = 7.80 (s, 1H); 5.21 (quintet, 1H); 2.52–2.70 (m, 1H); 2.20–2.38 (m, 4H); 1.87–2.00 (q, 1H); 1.65–1.80 (m, 1H); 1.17–1.38 (m, 4H);
I. a. 93	(CD ₃)Cl ₃ : σ = 7.82 (s, 1H); 4.37–4.45 (d, 2H); 2.21–2.30 (m, 1H); 1.37–1.51 (m, 1H); 1.13–1.30 (m, 4H); 0.65–0.78 (m, 2H); 0.45–0.52 (m, 2H);

20

30

【0275】

使用実施例

式Iのイソオキサゾロ[5,4-b]ピリジンの除草活性を、以下の温室実験によって実証された。

40

【0276】

使用した栽培容器は、ローム質の砂と、基質として約3.0%の腐食質とを含むプラスチック製の植木鉢であった。試験植物の種子は、それぞれの種ごとに別々に蒔いた。

【0277】

出芽前処理の場合は、水に懸濁又は乳化させておいた活性成分を、微細分散ノズルを用いて播種の直後に施用した。容器に穏やかに水を撒いて発芽および生長を促し、その後、植物が根付くまで透明のプラスチックフードで覆った。このカバーは、活性成分によって損なわれない限り、試験植物の均一な発芽をもたらした。

【0278】

出芽後処理の場合は、最初に、草性に応じて試験植物を3~15cmの草丈まで生長させ

50

、その後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、試験植物を同じ試験容器に直接播種して生長させるか、または最初に実生として別に生長させ、処理の数日前に試験容器に移植した。

【 0 2 7 9 】

種に応じて、植物は10～25 又は20～35 に置いておいた。試験期間は2～4週間に及んだ。この期間中、植物の世話をし、個々の処理に対するそれらの応答を評価した。

【 0 2 8 0 】

評価は、0～100の尺度を用いて行った。「100」は、植物が全く出芽しなかったこと、又は少なくとも気中部分が完全に破壊されていたことを意味し、「0」は、全く損傷がなかったこと、又は正常な生長過程にあったことを意味する。良好な除草活性には少なくとも80の値が与えられ、非常に良好な除草活性には少なくとも90の値が与えられる。

10

【 0 2 8 1 】

この温室実験に使用した植物は、以下の種に属する：

【表 3】

バイエルコード	学名	一般名
ABUTH	アブチロン・テオfrasチ (<i>Abutilon theophrasti</i>)	イチビ (velvet leaf)
AMARE	アマランツス・レトロフレクス (<i>Amaranthus retroflexus</i> L.)	アオゲイトウ (pigweed)
CHEAL	ケノポディウム・アルBUM (<i>Chenopodium album</i>)	アカザ (fat-hen)
SETFA	セタリア・ファベリ (<i>Setaria faberi</i>)	アキノエノコログサ (giant foxtail)
SETVI	セタリア・ビリジス (<i>Setaria viridis</i>)	エノコログサ (green foxtail)
POLCO	ポリゴナム・コンボルブルス (<i>Polygonum convolvulus</i>)	ソバカズラ (wild buckwheat)
ECHCG	エキノクロア・クルスーガリ (<i>Echinochloa crus-galli</i>)	イヌビエ (barnyard grass)

20

【表 4】

30

表 4：アブチロン・テオfrasチ (*Abutilon theophrasti*) (イチビ (velvet leaf)) の出芽後処理

化合物 no.	施用量 [kg/ha]	損傷 [%]
I. a. 40	1000	100

【表 5】

表 5 : アマランツス・レトロフレクス (Amaranthus retroflexus L.)
(アオゲイトウ (pigweed)) の出芽後処理

化合物 no.	施用量 [kg/ha]	損傷 [%]
I. a. 1	500	100
I. a. 59	500	98
I. a. 74	500	98
I. a. 44	1000	100
I. a. 66	1000	100
I. a. 79	500	100
I. a. 80	500	100
I. a. 82	500	100
I. a. 86	500	95
I. a. 87	500	80
I. a. 88	500	100
I. a. 89	500	70
I. a. 91	500	100
I. a. 92	500	100
I. a. 93	500	100

10

20

30

【表 6】

表 6 : ケノポディウム・アルBUM (Chenopodium album) (アカザ (fat-hen))
の出芽後処理

化合物 no.	施用量 [kg/ha]	損傷 [%]
I. a. 37	1000	100
I. a. 1	500	100
I. a. 59	500	98
I. a. 74	500	98
I. a. 44	1000	100
I. a. 46	1000	100
I. a. 67	1000	100
I. a. 66	1000	100
I. a. 80	500	98
I. a. 81	500	75
I. a. 87	500	70
I. a. 88	500	100
I. a. 89	500	70
I. a. 91	500	98
I. a. 92	500	100
I. a. 93	500	100

10

20

【表 7】

表 7 : セタリア・ファベリ (Setaria faberi) (アキノエノコログサ (giant foxtail))
の出芽後処理

化合物 no.	施用量 [kg/ha]	損傷 [%]
I. a. 40	1000	85

30

【表 8】

表 8 : ポリゴナム・コンボルブルス (Polygonum convolvulus) (ソバカズラ (wild buckwheat))
の出芽後処理

化合物 no.	施用量 [kg/ha]	損傷 [%]
I. a. 37	1000	100
I. a. 60	500	95
I. a. 67	1000	98
I. a. 79	500	85
I. a. 80	500	100
I. a. 93	500	100

40

【表 9】

表 9 : エキノクロア・クルス-ガリ (Echinochloa crus-galli) (イヌビエ (barnyard grass))
の出芽後処理

化合物 no.	施用量[kg/ha]	損傷[%]
I. a. 85	500	70
I. a. 87	500	75

【表 10】

表 10 : セタリア・ビリジス (Setaria viridis) (エノコログサ (green foxtail))
の出芽後処理

化合物 no.	施用量[kg/ha]	損傷[%]
I. a. 92	500	85

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2013/050080

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. A01N43/90 C07D498/04 A01P13/00
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)

A01N C07D

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)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	US 5 510 319 A (CROSS BARRINGTON [US] ET AL) 23 April 1996 (1996-04-23) lines 44-60 - column 5; claim 1; example 11	1-14
X,P	----- WO 2012/010633 A1 (BASF SE [DE]; MICHROWSKA-PIANOWSKA ANNA ALEKSANDRA [DE]; MAJOR JULIA []) 26 January 2012 (2012-01-26) example I.4.64 -----	1-14

☐ 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

19 February 2013

Date of mailing of the international search report

26/02/2013

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

Schuemacher, Anne

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2013/050080

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 5510319	A	23-04-1996	US 5252538 A 12-10-1993
			US 5510319 A 23-04-1996
			US 5532207 A 02-07-1996
			US 5534483 A 09-07-1996
			US 5534484 A 09-07-1996
			US 5534485 A 09-07-1996
			US 5536702 A 16-07-1996
			US 5536839 A 16-07-1996
			US 5554579 A 10-09-1996
			US 5563113 A 08-10-1996
			US 5565411 A 15-10-1996
			US 5571773 A 05-11-1996
			US 5599772 A 04-02-1997
			US 5599773 A 04-02-1997
			US 5622913 A 22-04-1997

WO 2012010633	A1	26-01-2012	AR 082262 A1 21-11-2012
			AU 2011281606 A1 07-02-2013
			WO 2012010633 A1 26-01-2012

フロントページの続き

(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, RU, TJ, 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, RO, 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, BN, 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, HU, 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, PA, 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

(74)代理人 100111741

弁理士 田中 夏夫

(74)代理人 100169971

弁理士 菊田 尚子

(74)代理人 100135909

弁理士 野村 和歌子

(72)発明者 ミクロウスカ - ピアノウスカ, アンナ, アレクサンドラ

ドイツ連邦共和国 6 8 1 6 7 マンハイム, ジークシュトラッセ 2 0

(72)発明者 コルデス, マルクス

ドイツ連邦共和国 6 7 2 2 7 フランケンタール, ベンスハイマー リング 1 3 デー

(72)発明者 ハツラー, ヨハネス

ドイツ連邦共和国 6 7 1 6 5 ヴァルトゼー, カール - ボッシュ - シュトラッセ 9

(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ッセ 3 0

(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ッセ 2 4

(72)発明者 クロイツ, クラウス

ドイツ連邦共和国 7 9 2 1 1 デンツリンゲン, ハウプトシュトラッセ 3 0 / 4

(72)発明者 グロースマン, クラウス

ドイツ連邦共和国 7 2 0 7 4 テュービンゲン, ヴァイアーシュトラッセ 3

(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 - シュトラッセ 1 0

(72)発明者 クルー, アンドレ ファン デル

オランダ国 エンエル - 6 8 1 5 アルンヘム, デ ウォルラーン 6

(72)発明者 ヴィチェル, 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 ベー

(72)発明者 パラ ラパド, リリアナ

ドイツ連邦共和国 7 7 6 5 4 オッフェンブルク, ヴァルター - ブルーメンシュトック - シュトラッセ 2 2

(72)発明者 レルヒル, イェンス

ドイツ連邦共和国 1 4 4 7 6 ゴルム, ゴルマー フィヒテン 5

F ターム(参考) 4C072 AA01 BB02 CC02 CC11 EE02 FF07 GG09 HH01 HH05 JJ03

UU02

4H011 AB01 BA01 BB10 BC01 BC05 BC06 BC07 BC20 DA02 DA15

DA16 DC05 DD03