

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2008年4月17日 (17.04.2008)

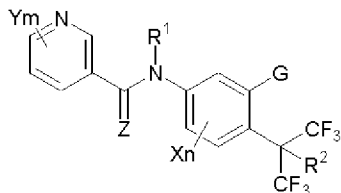
PCT

(10) 国際公開番号
WO 2008/044713 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 213/82 (2006.01) A01P 7/02 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01) A01P 7/04 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2007/069778
- (22) 国際出願日: 2007年10月10日 (10.10.2007)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願 2006-276895
2006年10月10日 (10.10.2006) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本農業株式会社 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1038236 東京都中央区日本橋1丁目2番5号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 古谷 敬 (FURUYA, Takashi) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農業株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 菅野 英夫 (KANNO, Hideo) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農業株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 諏訪 明之 (SUWA, Akiyuki) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農業株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 八十川 伯朗 (YASOKAWA, Noriaki) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内
- 長野市小山田町345 日本農業株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 藤岡 伸祐 (FUJIOKA, Shinsuke) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農業株式会社総合研究所内 Osaka (JP).
- (74) 代理人: 高島 一 (TAKASHIMA, Hajime); 〒5410044 大阪府大阪市中央区伏見町四丁目1番1号 明治安田生命大阪御堂筋ビル Osaka (JP).
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, 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, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- 添付公開書類:
— 国際調査報告書

(54) Title: SUBSTITUTED PYRIDINECARBOXANILIDE DERIVATIVE OR SALT THEREOF, AND AGRICULTURAL OR HORTICULTURAL AGENT, AND USE THEREOF

(54) 発明の名称: 置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体又はその塩類、及び農園芸用薬剤並びにその使用方法



(I)

(57) Abstract: Disclosed are: a substituted pyridinecarboxanilide derivative represented by the general formula (I) or a salt thereof; an agricultural or horticultural agent comprising the compound as an active ingredient; and use of the agent. It becomes possible to provide a novel agricultural or horticultural agent, particularly a pesticidal agent or a miticidal agent. (I) wherein R₁ represents H, an alkyl, an alkylcarbonyl, a cycloalkyl, a phenylalkyl, a phenylcarbonyl, a cyanoalkyl, or the like; R₂ represents H, a halogen, an alkyl, CN, OH, an alkoxy, a phenoxy, a phenylthio, a phenylsulfonyl, or the like; G represents an alkyl, an alkenyl, an alkynyl, a cycloalkyl, a cycloalkenyl, or the like; Z represents O or S; X represents a halogen, CN, NO₂, an alkyl, or the like; Y represents a halogen, CN, NO₂, OH, a mercapto, an amino, a carboxyl, an alkyl, a phenyl, a phenoxy, a heterocyclic group, or the like; m represents a number of 0 to 4; and n represents a number of 0 to 3.

(57) 要約: 本発明は、一般式 (I) {式中、R¹はH、アルキル、アルキルカルボニル、シクロアルキル、フェニルアルキル、フェニルカルボニル、シアノアルキル等; R²はH、ハロゲン、アルキル、CN、OH、アルコキシ、フェノキシ、フェニルチオ、フェニルスルホニル等; Gはアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル等; ZはO又はS; Xはハロゲン、CN、NO₂、アルキル等; Yはハロゲン、CN、NO₂、OH、メルカプト、アミノ、カルボキシル、アルキル、フェニル、フェノキシ、複素環基等、mは0~4; nは0~3。} で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体又はその塩類、及び該化合物を有効成分とする農園芸用薬剤並びにその使用方法に関する。本発明により、新規な農園芸用薬剤、特に殺虫剤又は殺ダニ剤が提供される。

WO 2008/044713 A1

明 細 書

置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体又はその塩類、及び農園芸用薬剤並びにその使用方法

技術分野

[0001] 本発明は置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体及びその塩類、及び該化合物を有効成分とする農園芸用薬剤、特に殺虫剤又は殺ダニ剤並びにその使用方法に関する。

背景技術

[0002] 従来、本発明類似の置換ピリジンカルボン酸アミド誘導体が農園芸用殺虫剤、殺菌剤又は殺ダニ剤として有用であることが知られている(例えば、特許文献1、2参照。) 。特許文献1に開示されている置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体は、アニリン部分の置換基が2位置換体に限られており、本発明記載の3位にアルキル基を導入した化合物は開示されていない。更に、そこに具体的に開示されている置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体は殺ダニ活性を示していない。また特許文献2に開示されている置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体は、アニリン部分の置換基がアルコキシ基に限定されており、本発明記載の3位にアルキル基を直接導入した化合物は開示されていない。

特許文献1:特開2003-48878号公報

特許文献2:特開2004-189738号公報

発明の開示

発明が解決しようとする課題

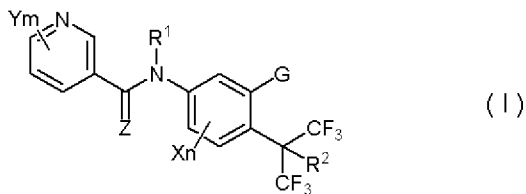
[0003] 農業及び園芸等の作物生産において、害虫等による被害は今なお大きく、既存薬に対する抵抗性害虫の発生等の要因から新規な農園芸用薬剤、特に殺虫剤又は殺ダニ剤の開発が望まれている。又、就農者の高齢化等により各種の省力的施用方法が求められるとともに、これらの施用方法に適した性格を有する農園芸用薬剤、特に殺虫剤又は殺ダニ剤の創出が求められている。

課題を解決するための手段

[0004] 本発明者等は新規な農園芸用薬剤、特に殺虫剤又は殺ダニ剤を開発すべく鋭意研究を重ねた結果、前記従来文献に記載された幅広い化合物群のうち、ヘテロ環カルボン酸部分としてピリジン環を選択し、アニリン部分3位に特定の置換基を導入した本発明の一般式(I)で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体が、殺ダニ剤として前記従来文献に記載された内容からは全く予想することの出来ない優れた防除効果を示すことを見だし、本発明を完成させたものである。

[0005] 即ち本発明は一般式(I)

[0006] [化1]



[0007] {式中、R¹は

- (1a) 水素原子、
- (2a) C₁₋₆-C₆ アルキル基、
- (3a) ハロC₁₋₆-C₆ アルキル基、
- (4a) C₁₋₆-C₆ アルキルカルボニルC₁₋₆-C₆ アルキル基、
- (5a) C₃₋₆-C₆ シクロアルキル基、
- (6a) ハロC₃₋₆-C₆ シクロアルキル基、
- (7a) C₃₋₆-C₆ シクロアルキルC₁₋₆-C₆ アルキル基、
- (8a) ハロC₃₋₆-C₆ シクロアルキルC₁₋₆-C₆ アルキル基、
- (9a) C₂₋₆-C₆ アルケニル基、
- (10a) ハロC₂₋₆-C₆ アルケニル基、
- (11a) C₂₋₆-C₆ アルキニル基、
- (12a) ハロC₂₋₆-C₆ アルキニル基、
- (13a) C₁₋₆-C₆ アルコキシC₁₋₆-C₆ アルキル基、
- (14a) ハロC₁₋₆-C₆ アルコキシC₁₋₆-C₆ アルキル基、
- (15a) C₁₋₆-C₆ アルコキシC₁₋₆-C₆ アルコキシC₁₋₆-C₆ アルキル基、
- (16a) C₁₋₆-C₆ アルキルチオC₁₋₆-C₆ アルキル基、

- (17a) ハロC₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルキル基、
- (18a) C₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₆アルキル基、
- (19a) ハロC₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₆アルキル基、
- (20a) C₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₆アルキル基、
- (21a) ハロC₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₆アルキル基、
- (22a) モノC₁-C₆アルキルアミノC₁-C₆アルキル基、
- (23a) 同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノC₁-C₆アルキル基、
- (24a) フェニルC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル基、
- (25a) C₁-C₆アルキルカルボニル基、
- (26a) ハロC₁-C₆アルキルカルボニル基、
- (27a) C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキルカルボニル基、
- (28a) C₁-C₆アルコキシカルボニル基、
- (29a) C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシカルボニル基、
- (30a) ハロC₁-C₆アルコキシカルボニル基、
- (31a) C₁-C₆アルキルチオカルボニル基、
- (32a) モノC₁-C₆アルキルアミノカルボニル基、
- (33a) 同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノカルボニル基、
- (34a) C₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₆アルキル基、
- (35a) C₁-C₆アルキルスルホニル基、
- (36a) ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、
- (37a) シアノC₁-C₆アルキル基、
- [0008] (38a) フェニルC₁-C₆アルキル基、
- (39a) 同一又は異なっても良く、
- (a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C₁-C₆アルキル基、(e) ハロC₁-C₆アルキル基、(f) C₁-C₆アルコキシ基、(g) ハロC₁-C₆アルコキシ基、(h) C₁-C₆アルキルチオ基、(i) ハロC₁-C₆アルキルチオ基、(j) C₁-C₆アルキルスルフィニル基、(k) ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、(l) C₁-C₆アルキルスルホニル基、(m) ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、(n) モノC₁-C₆アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジC₁-C₆ア

ルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1-C_6 アルキル基、

(40a) フェノキシカルボニル基、

(41a) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェノキシカルボニル基、

(42a) フェニルスルホニル基、

(43a) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルスルホニル基、

(44a) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルホスホノ基、

(45a) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルホスホノチオ基、

(46a) $N-C_1-C_6$ アルキル- $N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニルアミノチオ基、

(47a) $N-C_1-C_6$ アルキル- $N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニル C_1-C_6 アルキルアミノチオ基

、

(48a) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノチオ基、

(49a) C_3-C_6 シクロアルキルカルボニル基、

(50a) C_1-C_6 アルキル C_3-C_6 シクロアルキルカルボニル基、

(51a) フェニルC₃-C₆シクロアルキルカルボニル基、

(52a) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C₁-C₆アルキル基、(e) ハロC₁-C₆アルキル基、(f) C₁-C₆アルコキシ基、(g) ハロC₁-C₆アルコキシ基、(h) C₁-C₆アルキルチオ基、(i) ハロC₁-C₆アルキルチオ基、(j) C₁-C₆アルキルスルフィニル基、(k) ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、(l) C₁-C₆アルキルスルホニル基、(m) ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、(n) モノC₁-C₆アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、及び(p) C₁-C₆アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基をフェニル環上に有する置換フェニルC₃-C₆シクロアルキルカルボニル基、

(53a) C₂-C₆アルケニルオキシカルボニル基、

(54a) フェニルC₁-C₆アルコキシカルボニル基、

(55a) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C₁-C₆アルキル基、(e) ハロC₁-C₆アルキル基、(f) C₁-C₆アルコキシ基、(g) ハロC₁-C₆アルコキシ基、(h) C₁-C₆アルキルチオ基、(i) ハロC₁-C₆アルキルチオ基、(j) C₁-C₆アルキルスルフィニル基、(k) ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、(l) C₁-C₆アルキルスルホニル基、(m) ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、(n) モノC₁-C₆アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、及び(p) C₁-C₆アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC₁-C₆アルコキシカルボニル基、

(56a) フェニルC₁-C₆アルキルカルボニル基、又は

(57a) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C₁-C₆アルキル基、(e) ハロC₁-C₆アルキル基、(f) C₁-C₆アルコキシ基、(g) ハロC₁-C₆アルコキシ基、(h) C₁-C₆アルキルチオ基、(i) ハロC₁-C₆アルキルチオ基、(j) C₁-C₆アルキルスルフィニル基、(k) ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、(l) C₁-C₆アルキルスルホニル基、(m) ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、(n) モノC₁-C₆アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、及び(p) C₁-C₆アルコキシカルボニル基

ルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基
 から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1-C_6 アルキルカルボニ
 ル基
 を示す。

[0009] R^2 は

- (1b) 水素原子、
- (2b) ハロゲン原子、
- (3b) C_1-C_6 アルキル基、
- (4b) ハロ C_1-C_6 アルキル基、
- (5b) シアノ基、
- (6b) ヒドロキシ基、
- (7b) C_1-C_6 アルコキシ基、
- (8b) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、
- (9b) C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_3 アルコキシ基、
- (10b) ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_3 アルコキシ基、
- (11b) C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_3 アルコキシ基、
- (12b) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_3 アルコキシ基、
- (13b) C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_3 アルコキシ基、
- (14b) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_3 アルコキシ基、
- (15b) C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_3 アルコキシ基、
- (16b) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_3 アルコキシ基、
- (17b) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_3 アルコキシ基、
- (18b) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_3 アルコキシ基、
- (19b) C_1-C_6 アルキルチオ基、
- (20b) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、
- (21b) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、
- (22b) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、
- (23b) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、

(24b) ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、

(25b) アミノ基、

(26b) モノC₁-C₆アルキルアミノ基、

(27b) 同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、

[0010] (28b) フェノキシ基、

(29b) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C₁-C₆アルキル基、(e) ハロC₁-C₆アルキル基、(f) C₁-C₆アルコキシ基、(g) ハロC₁-C₆アルコキシ基、(h) C₁-C₆アルキルチオ基、(i) ハロC₁-C₆アルキルチオ基、(j) C₁-C₆アルキルスルフィニル基、(k) ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、(l) C₁-C₆アルキルスルホニル基、(m) ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、(n) モノC₁-C₆アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、及び(p) C₁-C₆アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェノキシ基、

(30b) フェニルチオ基、

(31b) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C₁-C₆アルキル基、(e) ハロC₁-C₆アルキル基、(f) C₁-C₆アルコキシ基、(g) ハロC₁-C₆アルコキシ基、(h) C₁-C₆アルキルチオ基、(i) ハロC₁-C₆アルキルチオ基、(j) C₁-C₆アルキルスルフィニル基、(k) ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、(l) C₁-C₆アルキルスルホニル基、(m) ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、(n) モノC₁-C₆アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、及び(p) C₁-C₆アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルチオ基、

(32b) フェニルスルフィニル基、

(33b) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C₁-C₆アルキル基、(e) ハロC₁-C₆アルキル基、(f) C₁-C₆アルコキシ基、(g) ハロC₁-C₆アルコキシ基、(h) C₁-C₆アルキルチオ基、(i) ハロC₁-C₆アルキルチオ基、(j) C₁-C₆アルキルスルフィニル基、(k) ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、(l) C₁-C₆アルキルスルホニル基、(m) ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、(n) モノC₁-C₆アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、及び(p) C₁-C₆アルコキシカルボニル基

ルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルスルフィニル基、

(34b) フェニルスルホニル基、

(35b) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルスルホニル基、

(36b) フェニル C_1-C_6 アルコキシ基、又は

(37b) 同一若しくは異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1-C_6 アルコキシ基を示す。

[0011] Gは

(1c) C_1-C_{10} アルキル基、

(2c) ハロ C_1-C_{10} アルキル基、

(3c) C_3-C_{10} アルケニル基、

(4c) ハロ C_3-C_{10} アルケニル基、

(5c) C_3-C_{10} アルキニル基、

(6c) ハロC₃-C₁₀ アルキニル基、

(7c) C₃-C₁₀ シクロアルキル基、

(8c) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) C₁-C₆ アルキル基、及び(c) ハロC₁-C₆ アルキル基から選択される1以上の置換基を有する置換C₃-C₁₀ シクロアルキル基、

(9c) C₃-C₁₀ シクロアルケニル基、

(10c) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) C₁-C₆ アルキル基、及び(c) ハロC₁-C₆ アルキル基から選択される1以上の置換基を有する置換C₃-C₁₀ シクロアルケニル基、

(11c) C₃-C₈ シクロアルキルC₁-C₆ アルキル基、又は

(12c) ハロC₃-C₈ シクロアルキルC₁-C₆ アルキル基を示す。

[0012] Zは酸素原子又は硫黄原子を示す。

nは0～3の整数を示す。

Xは同一又は異なっても良く、

(1d) ハロゲン原子、

(2d) シアノ基、

(3d) ニトロ基、

(4d) C₁-C₆ アルキル基、又は

(5d) ハロC₁-C₆ アルキル基を示す。

[0013] mは0～4の整数を示す。

Yは同一又は異なっても良く、

(1e) ハロゲン原子、

(2e) シアノ基、

(3e) ニトロ基、

(4e) 水酸基、

(5e) メルカプト基、

- (6e) アミノ基、
- (7e) カルボキシ基、
- (8e) C₁-C₆ アルキル基、
- (9e) ハロC₁-C₆ アルキル基、
- (10e) C₂-C₆ アルケニル基、
- (11e) ハロC₂-C₆ アルケニル基、
- (12e) C₂-C₆ アルキニル基、
- (13e) ハロC₂-C₆ アルキニル基、
- (14e) 同一又は異なっても良いトリC₁-C₆ アルキルシリルC₂-C₆ アルキニル基、
- (15e) フェニルC₂-C₆ アルキニル基、
- (16e) C₁-C₆ アルコキシC₁-C₆ アルコキシC₁-C₆ アルキル基、
- (17e) ヒドロキシC₁-C₆ アルキル基、
- (18e) C₁-C₆ アルキルカルボニルオキシC₁-C₆ アルキル基、
- (19e) C₃-C₆ シクロアルキル基、
- (20e) ハロC₃-C₆ シクロアルキル基、
- (21e) C₃-C₆ シクロアルキルC₁-C₆ アルキル基、
- (22e) ハロC₃-C₆ シクロアルキル C₁-C₆ アルキル基、
- (23e) C₁-C₆ アルコキシ基、
- (24e) ハロC₁-C₆ アルコキシ基、
- (25e) C₁-C₆ アルコキシC₁-C₆ アルコキシ基、
- (26e) ハロC₁-C₆ アルコキシC₁-C₆ アルコキシ基、
- (27e) フェニルC₁-C₆ アルコキシ基、
- (28e) C₁-C₆ アルコキシC₁-C₆ アルキル基、
- (29e) ハロC₁-C₆ アルコキシC₁-C₆ アルキル基、
- (30e) C₁-C₆ アルキルチオ基、
- (31e) ハロC₁-C₆ アルキルチオ基、
- (32e) C₁-C₆ アルキルスルフィニル基、
- (33e) ハロC₁-C₆ アルキルスルフィニル基、

- (34e) C₁-C₆ アルキルスルホニル基、
 (35e) ハロC₁-C₆ アルキルスルホニル基、
 (36e) C₁-C₆ アルキルチオC₁-C₆ アルキル基、
 (37e) ハロC₁-C₆ アルキルチオC₁-C₆ アルキル基、
 (38e) C₁-C₆ アルキルスルフィニルC₁-C₆ アルキル基、
 (39e) ハロC₁-C₆ アルキルスルフィニルC₁-C₆ アルキル基、
 (40e) C₁-C₆ アルキルスルホニルC₁-C₆ アルキル基、
 (41e) ハロC₁-C₆ アルキルスルホニルC₁-C₆ アルキル基、
 (42e) モノC₁-C₆ アルキルアミノ基、
 (43e) 同一又は異なっても良いジC₁-C₆ アルキルアミノ基、
 (44e) フェニルアミノ基、
 (45e) モノC₁-C₆ アルキルアミノC₁-C₆ アルキル基、
 (46e) 同一又は異なっても良いジC₁-C₆ アルキルアミノC₁-C₆ アルキル基、

[0014] (47e) フェニル基、

- (48e) 同一又は異なっても良く、
 (a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C₁-C₆ アルキル基、(e) ハロC₁-C₆ アルキル基、(f) C₁-C₆ アルコキシ基、(g) ハロC₁-C₆ アルコキシ基、(h) C₁-C₆ アルキルチオ基、(i) ハロC₁-C₆ アルキルチオ基、(j) C₁-C₆ アルキルスルフィニル基、(k) ハロC₁-C₆ アルキルスルフィニル基、(l) C₁-C₆ アルキルスルホニル基、(m) ハロC₁-C₆ アルキルスルホニル基、(n) モノC₁-C₆ アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジC₁-C₆ アルキルアミノ基、及び(p) C₁-C₆ アルコキシカルボニル基
 から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル基、

(49e) フェノキシ基、

(50e) 同一又は異なっても良く、

- (a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C₁-C₆ アルキル基、(e) ハロC₁-C₆ アルキル基、(f) C₁-C₆ アルコキシ基、(g) ハロC₁-C₆ アルコキシ基、(h) C₁-C₆ アルキルチオ基、(i) ハロC₁-C₆ アルキルチオ基、(j) C₁-C₆ アルキルスルフィニル基、(k) ハロC₁-C₆ アルキルスルフィニル基、(l) C₁-C₆ アルキルスルホニル基、(m) ハロC₁-C₆ アルキルスルホニル基、

ルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェノキシ基、

(51e) 複素環基、又は

(52e) 同一若しくは異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換複素環基を示す。又は、

(53e) ピリジン環上の隣接した2個のYは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有することもできる。}

で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体及びその塩類、該化合物を有効成分とする農園芸用薬剤並びにその使用方法に関する。

発明の効果

[0015] 本発明によれば、従来技術に比べて優れた性能を有する農園芸用薬剤、特に殺虫、殺ダニ剤を提供できる。

発明を実施するための最良の形態

[0016] 本発明の置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体の一般式(I)の定義において、各

置換基における「ハロ」、「C₁-C₆ アルキル」、「C₁-C₆ アルコキシ」、「C₂-C₆ アルケニル」、「C₂-C₆ アルキニル」又は「複素環基」等は以下の意味を示す。

「ハロ」又は「ハロゲン原子」とは、塩素原子、臭素原子、沃素原子又はフッ素原子を示す。

- [0017] 「C₁-C₆ アルキル」とは、直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキルを示し、例えば、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、t-ペンチル、2-メチルブチル、1-エチルプロピル、n-ヘキシル、2-エチルブチル、1, 2, 2-トリメチルプロピル等が挙げられる。
- [0018] 「C₁-C₁₀ アルキル」とは、直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～10個のアルキルを示し、例えば、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、t-ペンチル、2-メチルブチル、n-ヘキシル、2-エチルブチル、1, 2, 2-トリメチルプロピル、1-エチルプロピル、n-ヘプチル、n-オクチル、2-エチルヘキシル、n-ノニル、n-デシル等が挙げられる。
- [0019] 「C₃-C₆ シクロアルキル」とは、環状の炭素原子数3～6個のアルキルを示し、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等が挙げられる。
- [0020] 「C₃-C₈ シクロアルキル」とは、環状の炭素原子数3～8個のアルキルを示し、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロオクチル等が挙げられる。
- [0021] 「C₃-C₁₀ シクロアルキル」とは、環状の炭素原子数3～10個のアルキルを示し、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロオクチル、シクロデシル等が挙げられる。
- [0022] 「C₃-C₁₀ シクロアルケニル」とは、環状の炭素原子数3～10個のアルケニルを示し、例えば、シクロプロペニル、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロオクテニル、シクロデセニル等が挙げられる。
- [0023] 「C₁-C₃ アルコキシ」とは、そのアルキル部位が直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～3個のアルキルであるアルコキシを示し、例えば、メキシ、エトキシ、プロポキシ、イ

ソプロポキシ等が挙げられる。

[0024] 「C₁-C₆ アルコキシ」とは、そのアルキル部位が上記「C₁-C₆ アルキル」であるアルコキシを示し、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、t-ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ等が挙げられる。

[0025] 「C₂-C₆ アルケニル」とは、少なくとも1個の二重結合を有する直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2~6個のアルケニルを示し、例えば、ビニル、1-プロペニル、アリル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、2-ペンテニル、2-メチル-1-プロペニル、2, 4-ペンタジエニル、3-ヘキセニル等が挙げられる。

[0026] 「C₃-C₁₀ アルケニル」とは、少なくとも1個の二重結合を有する直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数3~10個のアルケニルを示し、例えば、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、2-ペンテニル、2, 4-ペンタジエニル、3-ヘキセニル、3-ヘプテニル、3-オクテニル、3-ノネニル、3-デセニル等が挙げられる。

[0027] 「C₂-C₆ アルキニル」とは、少なくとも1個の三重結合を有する直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2~6個のアルキニルを示し、例えば、エチニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、2-ペンチニル、3-ヘキシニル等が挙げられる。

[0028] 「C₃-C₁₀ アルキニル」とは、少なくとも1個の三重結合を有する直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数3~10個のアルキニルを示し、例えば、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、2-ペンチニル、3-ヘキシニル、3-ヘプチニル、3-オクチニル、3-ノニニル、3-デシニル等が挙げられる。

[0029] 又、「C₂-C₆」、「C₃-C₁₀」等の数字は炭素原子2個~6個、3個~10個のように炭素原子数の範囲を示す。

更に、上記置換基が連結した基についても上記定義を示すことができ、例えば、「ハロC₁-C₆ アルキル」の場合は、同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキル基を示し、例えば、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、パーフルオロヘキシル等が挙げられる。

[0030] 「複素環基」とは、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1以上のヘテ

ロ原子を有する5又は6員複素環基を示し、例えば、ピリジル基、ピリジン-N-オキシド基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフリル基、チエニル基、テトラヒドロチエニル基、テトラヒドロピラニル基、テトラヒドロチオピラニル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピラゾリル基等が挙げられる。

「縮合環」としては、例えば、ナフタレン、テトラヒドロナフタレン、インデン、インダン、キノリン、キナゾリン、インドール、インドリン、クロマン、イソクロマン、ベンゾジオキサン、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ジヒドロベンゾフラン、ベンゾチオフエン、ジヒドロベンゾチオフエン、ベンゾオキサゾール、ベンゾチアゾール、ベンズイミダゾール、インダゾール等が挙げられる。

[0031] 本発明の置換ピリジニカルボン酸アニリド誘導体の一般式(I)のうち、

R¹として好ましくは(1a) 水素原子、(2a) C₁-C₆アルキル基、(3a) ハロC₁-C₆アルキル基、(4a) C₁-C₆アルキルカルボニルC₁-C₆アルキル基、(9a) C₂-C₆アルケニル基、(10a) ハロC₂-C₆アルケニル基、(11a) C₂-C₆アルキニル基、(12a) ハロC₂-C₆アルキニル基、(13a) C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル基、(14a) ハロC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル基、(15a) C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル基、(25a) C₁-C₆アルキルカルボニル基、(26a) ハロC₁-C₆アルキルカルボニル基、(27a) C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキルカルボニル基、(28a) C₁-C₆アルコキシカルボニル基、(30a) ハロC₁-C₆アルコキシカルボニル基、(34a) C₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₆アルキル基、(37a) シアノC₁-C₆アルキル基、(38a) フェニルC₁-C₆アルキル基、(39a) 同一又は異なっても良く、(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C₁-C₆アルキル基、(e) ハロC₁-C₆アルキル基、(f) C₁-C₆アルコキシ基、(g) ハロC₁-C₆アルコキシ基、(h) C₁-C₆アルキルチオ基、(i) ハロC₁-C₆アルキルチオ基、(j) C₁-C₆アルキルスルフィニル基、(k) ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、(l) C₁-C₆アルキルスルホニル基、(m) ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、(n) モノC₁-C₆アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、及び(p) C₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC₁-C₆アルキル基、(40a) フェノキシカルボニル基、(41a) 同一又は異なっても良く、(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C₁-C₆

アルキル基、(e) ハロC₁-C₆アルキル基、(f) C₁-C₆アルコキシ基、(g) ハロC₁-C₆アルコキシ基、(h) C₁-C₆アルキルチオ基、(i) ハロC₁-C₆アルキルチオ基、(j) C₁-C₆アルキルスルフィニル基、(k) ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、(l) C₁-C₆アルキルスルホニル基、(m) ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、(n) モノC₁-C₆アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、及び(p) C₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェノキシカルボニル基、又は(49a) C₃-C₆シクロアルキルカルボニル基であり、更に好ましくは(1a) 水素原子、(2a) C₁-C₆アルキル基、(13a) C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル基、(25a) C₁-C₆アルキルカルボニル基、(27a) C₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキルカルボニル基、(28a) C₁-C₆アルコキシカルボニル、(37a) シアノC₁-C₆アルキル基、(49a) C₃-C₆シクロアルキルカルボニル基、(50a) C₁-C₆アルキルC₃-C₆シクロアルキルカルボニル基、(51a) フェニルC₃-C₆シクロアルキルカルボニル基、(52a) 同一又は異なっても良く、(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C₁-C₆アルキル基、(e) ハロC₁-C₆アルキル基、(f) C₁-C₆アルコキシ基、(g) ハロC₁-C₆アルコキシ基、(h) C₁-C₆アルキルチオ基、(i) ハロC₁-C₆アルキルチオ基、(j) C₁-C₆アルキルスルフィニル基、(k) ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、(l) C₁-C₆アルキルスルホニル基、(m) ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、(n) モノC₁-C₆アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、及び(p) C₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基をフェニル環上に有する置換フェニルC₃-C₆シクロアルキルカルボニル基、(53a) C₂-C₆アルケニルオキシカルボニル基、(54a) フェニルC₁-C₆アルコキシカルボニル基、(55a) 同一又は異なっても良く、(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C₁-C₆アルキル基、(e) ハロC₁-C₆アルキル基、(f) C₁-C₆アルコキシ基、(g) ハロC₁-C₆アルコキシ基、(h) C₁-C₆アルキルチオ基、(i) ハロC₁-C₆アルキルチオ基、(j) C₁-C₆アルキルスルフィニル基、(k) ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、(l) C₁-C₆アルキルスルホニル基、(m) ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、(n) モノC₁-C₆アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、及び(p) C₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC₁-C₆アルコキシカルボニル基、(56a) フェニルC₁-C₆アルキルカルボニル基、又は(57a) 同一又は異なっても良く、(a) ハロゲ

ン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1-C_6 アルキルカルボニル基であり、

さらに好ましくは(1a) 水素原子、(2a) C_1-C_6 アルキル基、(3a) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(4a) C_1-C_6 アルキルカルボニル C_1-C_6 アルキル基、(9a) C_2-C_6 アルケニル基、(10a) ハロ C_2-C_6 アルケニル基、(11a) C_2-C_6 アルキニル基、(12a) ハロ C_2-C_6 アルキニル基、(13a) C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、(14a) ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、(15a) C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、(25a) C_1-C_6 アルキルカルボニル基、(26a) ハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル基、(27a) C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキルカルボニル基、(28a) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、(30a) ハロ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、(37a) シアノ C_1-C_6 アルキル基、又は(49a) C_3-C_6 シクロアルキルカルボニル基であり、更に好ましくは(1a) 水素原子、(2a) C_1-C_6 アルキル基、(13a) C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、(25a) C_1-C_6 アルキルカルボニル基、(27a) C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキルカルボニル基、(28a) C_1-C_6 アルコキシカルボニル、(37a) シアノ C_1-C_6 アルキル基、又は(49a) C_3-C_6 シクロアルキルカルボニル基である。

[0032] R^2 として好ましくは(1b) 水素原子、(2b) ハロゲン原子、(3b) C_1-C_6 アルキル基、(4b) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(6b) ヒドロキシ基、(7b) C_1-C_6 アルコキシ基、(8b) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(9b) C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_3 アルコキシ基、又は(10b) ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_3 アルコキシ基であり、更に好ましくは(1b) 水素原子、(2b) ハロゲン原子、又は(7b) C_1-C_6 アルコキシ基である。

[0033] G として好ましくは(1c) C_1-C_{10} アルキル基、(2c) ハロ C_1-C_{10} アルキル基、(7c) C_3-C_{10} シクロアルキル基、又は(11c) C_3-C_8 シクロアルキル C_1-C_6 アルキル基であり、更に好ましくは(1c) C_2-C_{10} アルキル基である。

[0034] X として好ましくは(1d) ハロゲン原子、又は(4d) C_1-C_6 アルキル基であり、更に好まし

くはXが無置換を意味するnが0の場合である。

[0035] Yとして好ましくは(1e) ハロゲン原子、(8e) C_1-C_6 アルキル基、(9e) $ハロC_1-C_6$ アルキル基、(23e) C_1-C_6 アルコキシ基、(24e) $ハロC_1-C_6$ アルコキシ基、(30e) C_1-C_6 アルキルチオ基、又は(31e) $ハロC_1-C_6$ アルキルチオ基であり、更に好ましくは(1e) ハロゲン原子、(8e) C_1-C_6 アルキル基、(9e) $ハロC_1-C_6$ アルキル基、(23e) C_1-C_6 アルコキシ基、又は(30e) C_1-C_6 アルキルチオ基である。

mとして好ましくは1又は2であり、更に好ましくは1である。

Zとして好ましくは酸素原子である。

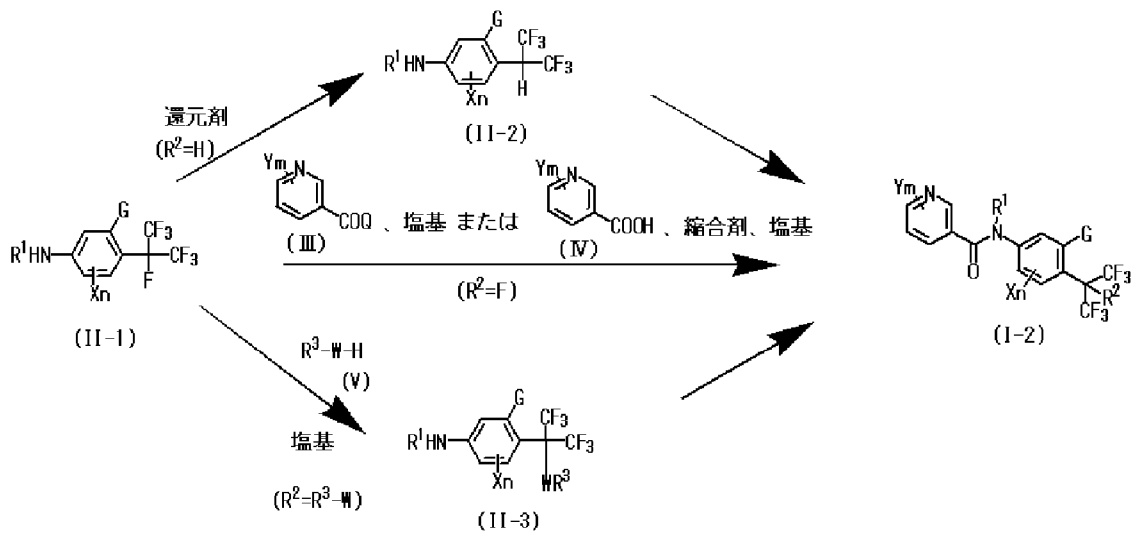
[0036] 本発明の一般式(I)で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体の塩としては、アルカリ金属(リチウム、ナトリウム、カリウム等)の塩、アルカリ土類金属(カルシウム、マグネシウム等)の塩、アンモニウム塩、有機アミン(メチルアミン、トリエチルアミン、ジエタノールアミン、ピペリジン、ピリジン等)の塩又は酸付加塩等が挙げられ、酸付加塩としては、例えば、酢酸塩、プロピオン酸塩、シュウ酸塩、トリフルオロ酢酸塩、安息香酸塩等のカルボン酸塩、メタンスルホン酸塩、トリフルオロメタンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩等のスルホン酸塩、塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、炭酸塩等の無機酸塩が挙げられる。

[0037] 本発明の一般式(I)で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体は、その構造中に1つ又は複数個の不斉中心を含む場合があり、2種以上の光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあり、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、本発明の一般式(I)で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体は、その構造中式中に炭素-炭素二重結合に由来する2種の幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明は各々の幾何異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。

[0038] 以下に本発明の一般式(I)で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体の代表的な製造方法を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

製造方法1

[0039] [化2]



[0040] (式中、 R^1 、 R^2 、 G 、 X 、 Y 、 m 及び n は前記に同じくし、 R^3 は水素原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、フェニル基、置換フェニル基又はフェニル C_1-C_4 アルキル基を示し、 W は $-O-$ 、 $-S-$ 又は $-N(R^4)-$ (式中、 R^4 は水素原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、フェニル基、置換フェニル基又はフェニル C_1-C_4 アルキル基を示す。)を示し、 Q はハロゲン原子又は C_1-C_6 アルコキシ基を示す。)

[0041] 一般式(I)で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体のうち、 Z が酸素原子で表され、 R^2 が水素原子、フッ素原子又は WR^3 (W および R^3 は前記と同じ。)で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体(I-2)は、一般式(II-1)～一般式(II-3)で表されるアニリン誘導体と一般式(III)で表されるピリジンカルボン酸ハライド又はピリジンカルボン酸エステルを塩基の存在下又は不存在下に、不活性溶媒中で反応させることにより、又は一般式(II-1)～一般式(II-3)で表されるアニリン誘導体と一般式(IV)で表されるピリジンカルボン酸を縮合剤の存在下に、塩基の存在下又は不存在下、不活性溶媒中で反応させることにより製造することができるが、通常のアミド類の製造方法であれば良い。

[0042] 一般式(II-2)で表されるアニリン誘導体は、一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体を還元剤の存在下、不活性溶媒中で還元することにより製造することができる。

一般式(II-3)で表されるアニリン誘導体は、一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体を塩基の存在下又は不存在下、不活性溶媒中で一般式(V)で表されるアルコール誘導体、チオール誘導体又はアミン誘導体と反応させることにより製造すること

ができる。

[0043] 一般式(II-1)→一般式(II-2)

本反応で使用できる還元剤としては、水素化リチウムアルミニウム、水素化ホウ素リチウム、水素化ホウ素ナトリウム、ジイソブチルアルミニウムヒドリド、水素化ビス(2-メトキシエトキシ)アルミニウムナトリウム等の金属水素化物、金属リチウム等の金属又は金属塩等を例示することができ、その使用量は一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体に対して当量乃至過剰量の範囲から適宜選択して使用すれば良い。

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン(THF)等の鎖状又は環状エーテル類等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至50時間の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。又、反応系から目的物を単離せずに次の反応工程に供することも可能である。

[0044] 一般式(II-1)→一般式(II-3)

本反応で使用できる塩基としては水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属水素化物、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシド等の金属アルコラート類、n-ブチルリチウム、s-ブチルリチウム、t-ブチルリチウム等のアルキル金属類を例示することができ、その使用量は一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体に対して当量乃至過剰量の範囲から適宜選択して使用すれば良い。

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類等の不活性溶媒を例示すること

ができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

反応温度は -70°C 乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至50時間の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。又、反応系から目的物を単離せずに次の反応工程に供することも可能である。

[0045] 一般式(II-1)、一般式(II-2)又は一般式(II-3)→一般式(I-2)

本反応で使用する縮合剤としては、例えばシアニン酸ジエチル(DEPC)、カルボニルジイミダゾール(CDI)、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)、クロロ炭酸エステル類、ヨウ化2-クロロ-1-メチルピリジニウム等を例示することができる。

本反応で使用する塩基としては、無機塩基又は有機塩基が挙げられ、無機塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属原子の水酸化物や水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属の水素化物、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシド等のアルコールのアルカリ金属塩、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の炭酸塩類、有機塩基としては、例えばトリエチルアミン、ピリジン、DBU等を例示ことができ、その使用量は一般式(III)又は(IV)で表されるピリジンカルボン酸誘導体に対して等モル乃至過剰モルの範囲から選択して使用すれば良い。

[0046] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン及びアセトン、メチルエチルケトン等の不活性溶媒を例示ことができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもでき、反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で行えば良い。

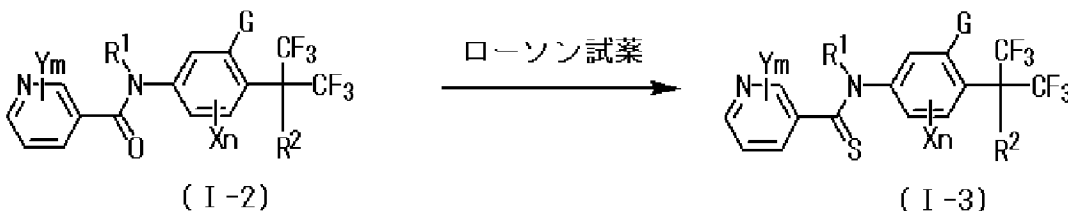
反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

本反応の原料化合物である一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体は、特開平11-302233号公報又は特開2001-122836号公報に開示の製造方法等に準じて製造することができる。

[0047] 又、一般式(III)又は(IV)で表されるピリジンカルボン酸誘導体は公知文献(例えば、Industrie Chimique Belge (1967), 32, 165、特開平03-52862号公報、特開平03-81263号公報、J. Chem. Soc., Perkin Trans I, 1984, 1501等。)記載の方法に準じて製造することができる。

[0048] 製造方法2

[0049] [化3]

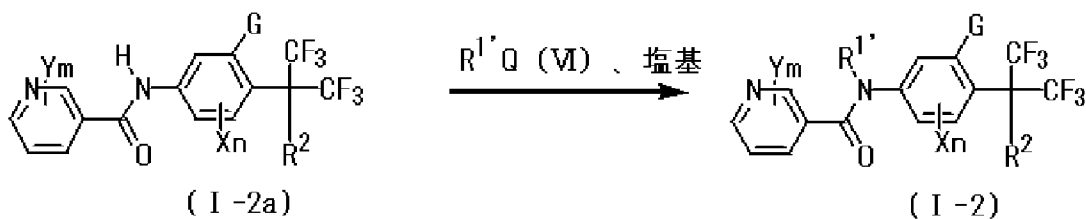


[0050] (式中、R¹、R²、G、X、Y、m及びnは前記に同じ。)

一般式(I)で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体のうち、Zが硫黄原子で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体(I-3)は、(I-2)で表されるアニリン誘導体を公知の方法(Tetrahedron Lett., 21(42), 4061(1980))に準じてローソン試薬と反応させることにより製造することができる。

[0051] 製造方法3

[0052] [化4]



[0053] (式中、 R^2 、 G 、 X 、 Y 、 Q 、 m 及び n は前記に同じ。 $R^{1'}$ は R^1 に同じくし、但し水素原子は除く。)

一般式(I)で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体のうち、 R^1 が水素原子以外の置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体(I-2)は、一般式(I-2a)で表されるアミド誘導体と一般式(VI)で表されるハライド誘導体又はエステル誘導体を塩基の存在下又は不存在下に、不活性溶媒中で反応させることにより製造することができる。

[0054] 本反応で使用できる塩基としては水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属水素化物、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム t -ブトキシド等の金属アルコラート類、 n -ブチルリチウム、 s -ブチルリチウム、 t -ブチルリチウム等のアルキル金属類を例示することができ、その使用量は一般式(I-2a)で表されるアミド誘導体に対して当量乃至過剰量の範囲から適宜選択して使用すれば良い。

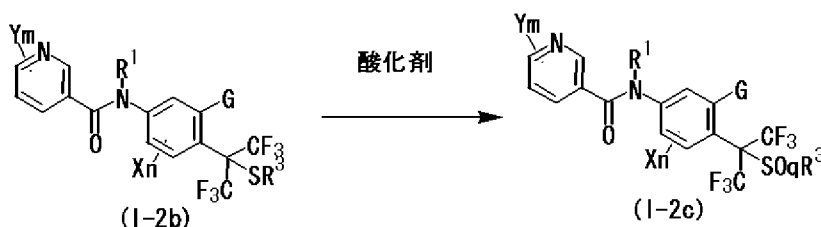
本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、ジエチルエーテル、1, 2-ジメトキシエタン、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

反応温度は -70°C 乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至50時間の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0055] 製造方法4

[0056] [化5]

[0057] (式中、G、R¹、R³、X、n、Y及びmは前記に同じくし、qは1又は2を示す。)

又、一般式(I-2c)で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体は、製造方法1で製造できる一般式(I-2b)で表されるスルフィド誘導体を不活性溶媒の存在下、酸化剤と反応させることにより製造できる。

本反応で使用する不活性溶媒としては、例えば塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、フルオロベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、酢酸等の酸類、メタノール、エタノール、プロパノール等のアルコール類を例示することができる。

酸化剤としては、例えばメタクロ過安息香酸、過酢酸、メタ過ヨウ素酸カリウム、過硫酸水素カリウム(オキシソ(登録商標))、過酸化水素等を例示することができ、その使用量は一般式(I-2b)で表されるスルフィド誘導体に対して0.5~3当量の範囲から適宜選択して使用すれば良い。

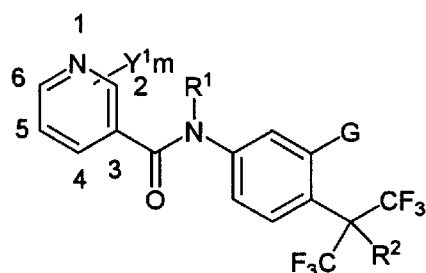
反応温度は-50℃~使用する不活性溶媒の沸点域の範囲で行えば良く、反応時間は反応温度、反応規模等により一定しないが、数分乃至24時間の範囲である。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法に従って単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0058] 一般式(I)で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体の代表的な化合物を第1表に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。又、第1表中の「物性」欄には融点(℃)又は屈折率[n_D(℃)]を記載し、アモルファスと記載した化合物については、その¹H-NMRデータを第2表に示した。尚、表中、「n-」はノルマルを、「i-」はイソを、「t-」はターシャリーを、「c-」はシクロを、「Me」はメチル基を、「Et」はエチル基を、「Pr」はプロピル基を、「Bu」はブチル基を、「Pen」はペンチル基

を、「Hex」はヘキシル基を、「Ac」はアセチル基を、「1-Ph-c-Pr」は1-フェニル-シクロプロピル基を、「1-Me-c-Pr」は1-メチル-シクロプロピル基を示す。

[0059] [表1-1]



(1-4)

第1表

No.	G	Y ¹ _m	R ¹	R ²	物性
1-1	i-Bu	2-Me	H	F	154.6-158.9
1-2	i-Bu	2-Cl	H	F	175.6-175.7
1-3	i-Bu	2-OMe	H	F	121.4-123.7
1-4	i-Bu	2-Cl	CH ₂ OEt	F	1.4909(22.8)
1-5	i-Bu	2-Me	CO-i-Pr	F	1.4880(25.0)
1-6	i-Bu	2-Me	CO-t-Bu	F	1.4872(23.6)
1-7	n-Pen	2-Me	H	H	1.5213(19.8)
1-8	i-Bu	2-Me	H	H	175-178
1-9	i-Bu	2-OMe	H	H	109-109.5
1-10	i-Bu	2-SMe	H	H	127-128
1-11	i-Bu	2-CF ₃	H	H	163-164
1-12	i-Bu	6-Me	H	H	120-124
1-13	i-Bu	4-Me	H	H	142-142.5
1-14	i-Bu	4-CF ₃	H	H	131-133
1-15	i-Bu	2-F	H	H	124-125
1-16	i-Bu	2-Cl	H	H	66-70
1-17	i-Bu	H	H	H	118-119
1-18	i-Bu	2-Cl-6-Me	H	H	114-118
1-19	i-Bu	2-Me-6-CF ₃	H	H	1.4872(21.3)

[0060] [表1-2]

第1表(続き)

No.	G	Y ¹ _m	R ¹	R ²	物性
1-20	i-Bu	2,6-Me ₂	H	H	55-58
1-21	i-Bu	2,6-Me ₂ -4-Cl	H	H	116-118
1-22	i-Bu	2-Me	CH ₂ OEt	H	1.4891(26.8)
1-23	i-Bu	H	H	OMe	145.1-146.3
1-24	i-Bu	2-CF ₃	H	OMe	158.7-160.0
1-25	i-Bu	2-Me	H	OMe	174-175
1-26	i-Bu	2-SMe	H	OMe	173.3-179.9
1-27	i-Bu	2-OMe	H	OMe	137.3-139.4
1-28	i-Bu	2-CF ₃	CH ₂ OEt	OMe	1.4745(27.1)
1-29	i-Bu	2-CF ₃	CO-i-Pr	OMe	146.8-146.9
1-30	i-Bu	2-SMe	COEt	OMe	1.4460(27.5)
1-31	i-Bu	2-SMe	CO-i-Pr	OMe	アモルファス
1-32	i-Bu	2-SMe	CH ₂ OEt	OMe	1.4018(27.6)
1-33	i-Bu	2-SMe	COOEt	OMe	アモルファス
1-34	i-Bu	H	CO-i-Pr	OMe	100.8-102.0
1-35	i-Bu	2-Me	Me	OMe	92.7-100.3
1-36	i-Bu	2-Me	i-Bu	OMe	アモルファス
1-37	i-Bu	2-Me	COOEt	OMe	1.4891(27.6)
1-38	i-Bu	2-Me	COO-i-Bu	OMe	1.4903(23.1)
1-39	i-Bu	2-Me	CH ₂ OEt	OMe	1.4921(28.3)
1-40	i-Bu	2-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1.4931(23.3)
1-41	i-Bu	2-Me	Ac	OMe	101.3-102.8
1-42	i-Bu	2-Me	COEt	OMe	1.4990(23.6)
1-43	i-Bu	2-Me	CO-n-Pr	OMe	1.4951(24.7)
1-44	i-Bu	2-Me	CO-i-Pr	OMe	1.4961(25.4)
1-45	i-Bu	2-Me	CO-c-Pr	OMe	1.4911(22.7)

[0061] [表1-3]

第1表(続き)

No.	G	Y ¹ _m	R ¹	R ²	物性
1-46	i-Bu	2-Me	CO-n-Bu	OMe	1.4941(25.7)
1-47	i-Bu	2-Me	CO-t-Bu	OMe	102.8-103.2
1-48	i-Bu	2-Me	COCHMeEt	OMe	112.2-113.2
1-49	i-Bu	2-Me	COCHEt ₂	OMe	128.9
1-50	i-Bu	2-Me	CO-c-Pen	OMe	1.5056(26.1)
1-51	i-Bu	2-Me	CO-c-Hex	OMe	1.5004(26.6)
1-52	i-Bu	2-Me	COCH ₂ OMe	OMe	1.5052(25.4)
1-53	i-Bu	2-Me	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1.4872(27.6)
1-54	i-Bu	2-Me	CH ₂ O-n-Bu	OMe	1.4879(27.6)
1-55	i-Bu	2-Me	CH ₂ O-i-Bu	OMe	1.4850(27.8)
1-56	i-Bu	2-OMe	CH ₂ CN	OMe	1.4993(25.4)
1-57	i-Bu	2-OMe	CO-i-Pr	OMe	1.4992(26.1)
1-58	i-Bu	2-OMe	CH ₂ O-i-Pr	OMe	88.9-90.4
1-59	i-Bu	2-Me	CH ₂ OMe	OMe	1.4938(26.0)
1-60	i-Bu	2-Me	CH ₂ O-i-Pr	F	1.4731(26.0)
1-61	i-Bu	2-Me	COOMe	OMe	1.4973(30.0)
1-62	i-Bu	2-Me	COO-n-Pr	OMe	1.4904(30.5)
1-63	i-Bu	2-Me	COO-i-Pr	OMe	1.4853(28.8)
1-64	i-Bu	2-Me	COO-Allyl	OMe	1.4972(33.2)
1-65	i-Bu	2-Me	COO-n-Bu	OMe	1.4910(30.0)
1-66	i-Bu	2-Me	COOCH ₂ -Ph	OMe	1.4970(31.7)
1-67	i-Bu	2-Me	COO-Ph	OMe	アモルファス
1-68	i-Bu	2-Me	COC ₂ H ₄ -Ph	OMe	1.5009(28.7)
1-69	i-Bu	2-Me	CO-(1-Ph-c-Pr)	OMe	アモルファス
1-70	i-Bu	2-Me	COCH(Me)-t-Bu	OMe	1.4819(32.1)

[0062] [表1-4]

第1表(続き)

No.	G	Y ¹ _m	R ¹	R ²	物性
1-71	i-Bu	2-Br	H	OMe	197.9-198.3
1-72	i-Bu	2-Br	CO-Et	OMe	アモルファス
1-73	i-Bu	2-Br	CO-i-Pr	OMe	146.0-146.3
1-74	i-Bu	2-Br	CO-n-Pr	OMe	103.1-103.8
1-75	i-Bu	2-Br	COO-i-Bu	OMe	101.6-102.4
1-76	i-Bu	2-Br	CH ₂ OEt	OMe	1.4493(20.0)
1-77	i-Bu	2-Br	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1.4521(20.4)
1-78	i-Bu	2-Me	CO-(1-Me-c-Pr)	OMe	96.5-96.7
1-79	i-Bu	2-Cl	H	OMe	189.2
1-80	i-Bu	2-Cl	CO-i-Pr	OMe	134.4-135.2
1-81	i-Bu	2-Cl	COO-i-Bu	OMe	90.3-92.6
1-82	i-Bu	2-Cl	CH ₂ OEt	OMe	1.4980(20.6)
1-83	i-Bu	2-Me	COO-i-Bu	H	1.4814(22.0)
1-84	i-Bu	2-Me	CH ₂ CH ₂ -(4-Cl-Ph)	F	アモルファス
1-85	i-Bu	2-Br	H	F	183.3
1-86	i-Bu	2-Br	CO-i-Pr	F	1.4988(22.9)
1-87	i-Bu	2-Br	CO-c-Pen	F	113.9-116.3
1-88	i-Bu	2-Br	CH ₂ OEt	F	1.4687(24.4)
1-89	i-Bu	2-Br	CO-c-Pen	OMe	1.4756(28.2)
1-90	i-Bu	2-Br	CO-c-Hex	OMe	130.3-132.3
1-91	i-Bu	2-Br	CH ₂ COOEt	OMe	1.4819(27.2)

[0063] [表2]

第2表

No.	¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ 値(ppm)]
1-31	8.40 (m, 1H), 7.52 (m, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.28 (m, 1H), 7.16(m, 1H), 6.91(m, 1H), 3.44 (s, 3H), 3.16 (m, 1H), 2.89 (d, 2H), 2.59 (s, 3H), 2.07 (m, 1H), 1.23 (d, 6H), 0.78 (d, 6H)
1-33	8.52 (m, 1H), 7.64 (m, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.27 (m, 1H), 7.09 (m, 1H), 4.12 (q, 2H), 3.50 (s, 3H), 2.96 (d, 2H), 2.63 (s, 3H), 2.16 (m, 1H), 1.03 (t, 3H), 0.92 (d, 6H)
1-36	8.31 (br, 1H), 7.36 (br, 1H), 7.24 (br, 1H), 6.98 (br, 2H), 6.84 (br, 1H), 3.83 (br, 2H), 3.38 (s, 3H), 2.76 (br, 2H), 2.60 (s, 3H), 1.17 (br, 2H), 0.99 (br, 6H), 0.74 (br, 6H)
1-67	8.58 (m, 1H), 7.76 (m, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.32-7.18 (m, 5H), 6.91 (m, 2H), 3.52 (s, 3H), 3.00 (d, 2H), 2.76 (s, 3H), 2.19 (m, 1H), 0.94 (d, 6H)
1-69	8.45 (m, 1H), 7.37-6.98 (m, 5H), 7.02 (m, 3H), 6.75 (m, 2H), 3.44 (s, 3H), 2.74 (d, 2H), 2.60 (s, 3H), 1.90 (m, 1H), 1.77 (m, 2H), 1.27 (m, 2H), 0.78 (d, 6H)
1-72	8.37 (m, 1H), 7.60 (m, 2H), 7.42 (m, 1H), 7.32-7.20 (m, 2H), 3.49 (s, 3H), 2.95 (d, 2H), 2.53 (q, 2H), 2.13 (m, 1H), 1.12 (t, 3H), 0.70 (d, 6H)
1-84	8.34 (m, 1H), 7.31-7.22 (m, 6H), 7.07 (m, 1H), 6.88 (m, 2H), 5.08 (s, 2H), 2.58 (s, 3H), 2.44 (m, 2H), 1.54 (m, 1H), 0.65 (d, 6H)

[0064] 本発明の一般式(I)で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体又はその塩類を有効成分として含有する農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤、又は殺ダニ剤は水稲、果樹、野菜、その他の作物及び花卉用を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫等の害虫防除に適しており、例えばリンゴコカクモンハマキ(*Adoxophyes orana fasciata*)、チャノコカクモンハマキ(*Adoxophyes* sp.)、リンゴシンクイ(*Grapholita inopinata*)、ナシヒメシンクイ(*Grapholita molesta*)、マメシンクイガ(*Leguminivora glycinivorella*)、クワハマキ(*Olethreutes mori*)、チャノホソガ(*Caloptilia thevovora*)、リンゴホソガ(*Caloptilia zachrysa*)、キンモンホソガ(*Phyllonorycter ringoniella*)、ナシホソガ(*Spulerrina astaurota*)、モンシロチョウ(*Piers rapae crucivora*)、オオタバコガ類(*Heliothis* sp.)、コドリंगा(*Laspeyresia pomonella*)、コナガ(*Plutella xylostella*)、リンゴヒメシンクイ(*Argyresthia conjugella*)、モモシンクイガ(*Carposina niponensis*)、ニカメイガ(*Chilo suppressalis*)、コブノメイガ(*Cnaphalocrocis medinalis*)、チャマダラメイガ(*Ephestia elutella*)、クワノメイガ(*Glyphodes pyloalis*)、サンカメイガ

(*Scirpophaga incertulas*)、イチモンジセセリ(*Parnara guttata*)、アワヨトウ(*Pseudaletia separata*)、イネヨトウ(*Sesamia inferens*)、ハスモンヨトウ(*Spodoptera litura*)、シロイチモジヨトウ(*Spodoptera exigua*)等の鱗翅目害虫、

[0065] フタテンヨコバイ(*Macrosteles fascifrons*)、ツマグロヨコバイ(*Nephotettix cincticeps*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ(*Sogatella furcifera*)、ミカンキジラミ(*Diaphorina citri*)、ブドウコナジラミ(*Aleurolobus taonabae*)、タバココナジラミ(*Bemisia tabaci*)、オンシツコナジラミ(*Trialeurodes vaporariorum*)、ニセダイコンアブラムシ(*Lipaphis erysimi*)、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)、ツノロウムシ(*Ceroplastes ceriferus*)、ミカンワタカイガラムシ(*Pulvinaria aurantii*)、ミカンマルカイガラムシ(*Pseudaonidia duplex*)、ナシマルカイガラムシ(*Comstockaspis perniciosa*)、ヤノネカイガラムシ(*Unaspis yanonensis*)等の半翅目害虫、ヒメコガネ(*Anomala rufocuprea*)、マメコガネ(*Popilla japonica*)、タバコシバンムシ(*Lasioderma serricorne*)、ヒラタキクイムシ(*Lyctus brunneus*)、ニジュウヤホシテントウ(*Epilachna vigintiotopunctata*)、アズキゾウムシ(*Callosobruchus chinensis*)、ヤサイゾウムシ(*Listroderes costirostris*)、コクゾウムシ(*Sitophilus zeamais*)、ワタミゾウムシ(*Anthonomus grandis grandis*)、イネミゾゾウムシ(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、ウリハムシ(*Aulacophora femoralis*)、イネドロオイムシ(*Oulema oryzae*)、キスジノミハムシ(*Phyllotreta striolata*)、マツノキクイムシ(*Tomocus piniperda*)、コロラドポテトビートル(*Leptinotarsa decemlineata*)、メキシカンビーンビートル(*Epilachna varivestis*)、コーンルートワーム類(*Diabrotica* sp.)等の甲虫目害虫、

[0066] ウリミバエ(*Dacus (Zeugodacus) cucurbitae*)、ミカンコミバエ(*Dacus (Bactrocera) dorsalis*)、イネハモグリバエ(*Agromyza oryzae*)、タマネギバエ(*Delia antiqua*)、タネバエ(*Dalia platura*)、ダイズサヤタマバエ(*Asphondylis* sp.)等の双翅目害虫、ミナミネグサレセンチュウ(*Pratylenchus coffeae*)、ジャガイモシストセンチュウ(*Glabodera rostchiensis*)、ネコブセンチュウ(*Meloidogyne* sp.)、ミカンネセンチュウ(*Tylenchulus semipenetrans*)、ニセネグサレセンチュウ(*Aphelenchus avenae*)、ハガレセンチュウ(*Aphelenchoides ritzemabosi*)等のハリセンチュウ目害虫、ミカンハダニ(*Panonychus citri*)、リンゴハダニ(*Panonychus ulmi*)、ニセナミハダニ(*Tetranychus cinnabarinus*)、カンザワハ

ダニ(Tetranychus kanzawai Kishida)、ナミハダニ(Tetranychus urticae Koch)、チャノガサビダニ(Acaphylla theae)、ミカンサビダニ(Aculops pelekassi)、チャノサビダニ(Calacarus carinatus)、ナシサビダニ(Epitrimerus pyri)等のダニ目害虫に対して強い殺虫効果を有するものである。

[0067] 本発明の一般式(I)で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体又はその塩類は、農園芸用殺虫剤又は殺ダニ剤としての使用が好ましいが、森林・木材用害虫、畜産用害虫、衛生用害虫等の種々の害虫類に対して優れた防除効果を示し、幅広い分野で害虫防除剤として使用することができ、これらの害虫類としては、例えば、例えば、ヤマトアブ(Tabanus rufidens Bigot)等のアブ科、イエバエ(Musca domestica uicina MACQUART)等のイエバエ科、ウマバエ(Gasterophilus intestinalis)等のウマバエ科、ウシバエ(Hypoderma bovis L.)等のウシバエ科、オオキモンノミバエ(Megaselia spiracularis)等のノミバエ科、アカイエカ(Culex pipiens pallens)、シマハマダラカ(Anopheles sinensis)、ヒトスジシマカ(Aedes albopictus)、ヤマトヤブカ(Aedes japonicus)等のカ科、ネコノミ(Ctenocephalides felis)、イヌノミ(Ctenocephalides canis)、ヒトノミ(Pulex irritans)等のヒトノミ科、ヤマトマダニ(Ixodes ovatus Neumann)等のマダニ科、モンシロドクガ(Euproctis similis)等のドクガ科、コクゾウムシ(Sitophilus zeamais)等のオサゾウムシ科、キロスズメバチ(Vespa simillima xanthoptera Cameron)等のスズメバチ科、チャバネゴキブリ(Blattella germanica)等のチャバネゴキブリ科、ワモンゴキブリ(Periplaneta americana)、ヤマトゴキブリ(Periplaneta japonica)等のゴキブリ科、ケジラミ(Phthirus pubis)等のケジラミ科、ヤマトシロアリ(Reticulitermes speratus)、イエシロアリ(Coptotermes formosanus)等のシロアリ科、シュルツエマダニ(Ixodes persulcatus)等のマダニ科、イエダニ(Ornithonyssus bacoti)等のオオサシダニ科等を挙げることができる。

[0068] 本発明の一般式(I)で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体又はその塩類を有効成分とする農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤又は殺ダニ剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するので、害虫の発生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で水田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の種子、水田水、茎葉又は土壌に処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所

期の効果が奏せられるものである。

本発明の農園芸用薬剤を使用できる植物は特に限定されるものではないが、例えば以下に示した植物が挙げられる。

[0069] 穀類(例えば、稲(*Oryza sativa*)、大麦(*Hordeum vulgare*)、小麦(*Triticum aestivum* L.)、ライ麦(*Secale cereale*)、オート麦(*Avena*)、トウモロコシ(*Zea mays* L.)、高粱等)、豆類(大豆、小豆、そら豆、えんどう豆、落花生等)、果樹・果実類(リンゴ、柑橘類、梨、ブドウ、桃、梅、桜桃、クルミ、アーモンド、バナナ、イチゴ等)、野菜類(キャベツ、トマト、ほうれん草、ブロッコリー、レタス、タマネギ、ネギ、ピーマン等)、根菜類(ニンジン、馬鈴薯、サツマイモ、大根、蓮根、かぶ等)、加工用作物類(綿、麻(*Linum usita tissimum*)、コウゾ(*Broussonetia kasinoki* SIEB)、ミツマタ(*Edgeworthia papyrifera*)、菜種(*Brassica napus* L.)、ビート(*Beta vulgaris*)、ホップ、サトウキビ(*Saccharum officinarum*)、テンサイ(*Beta vulgaris* var. *saccharifera*)、オリーブ、ゴム、コーヒー、タバコ、茶等)、瓜類(カボチャ、キュウリ、スイカ、メロン等)、牧草類(オーチャードグラス、ソルガム、チモシー、クローバー、アルファルファ等)、芝類(高麗芝、ベントグラス等)、香料等用作物類(ラベンダー(*Lavandula officinalis* CHAIX)、ローズマリー、タイム、パセリ、胡椒、しょうが等)、花卉類(キク、バラ、蘭等)等の植物に使用できる。

[0070] また、近年、遺伝子組み換え作物(除草剤耐性作物、殺虫性タンパク産生遺伝子を組み込んだ害虫耐性作物、病害に対する抵抗性誘導物質産生遺伝子を組み込んだ病害耐性作物、食味向上作物、保存性向上作物、収量向上作物など)、昆虫性フェロモン(ハマキガ類、ヨトウガ類の交信攪乱剤など)、天敵昆虫などを用いたIPM(総合的害虫管理)技術が進歩しており、本発明の農薬組成物はそれらの技術と併用、あるいは体系化して用いることができる。

[0071] 本発明の農園芸用薬剤は、農薬製剤上の常法に従い使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。

即ち、一般式(I)で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体又はその塩類はこれらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させて適宜の剤型、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、パック剤等に製剤し

て使用すれば良い。

[0072] 本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、固体の担体になりうる材料としては、例えばダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、繊維素粉末、植物エキス抽出後の残渣、粉碎合成樹脂等の合成重合体、粘土類(例えばカオリン、ベントナイト、酸性白土等)、タルク類(例えばタルク、ピロフィライト等)、シリカ類(例えば珪藻土、珪砂、雲母、ホワイトカーボン(含水微粉珪素、含水珪酸ともいわれる合成高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。))、活性炭、イオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、レンガ粉碎物、フライアッシュ、砂、炭酸カルシウム、燐酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン等のプラスチック担体、硫酸、燐安、硝安、尿素、塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以上の混合物の形で使用される。

[0073] 液体の担体になりうる材料としては、それ自体溶媒能を有するものの他、溶媒能を有さずとも補助剤の助けにより有効成分化合物を分散させうるものから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できるが、これらは単独で若しくは2種以上の混合物の形で使用され、例えば水、アルコール類(例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール等)、ケトン類(例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等)、エーテル類(例えばエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等)、脂肪族炭化水素類(例えばケロシン、鉱油等)、芳香族炭化水素類(例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等)、ハロゲン化炭化水素類(例えばジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素、塩素化ベンゼン等)、エステル類(例えば酢酸エチル、ジイソピルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート等)、アミド類(例えばジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等)、ニトリル類(例えばアセトニトリル等)、ジメチルスルホキシド類等を挙げることができる。

[0074] 他の補助剤としては次に例示する代表的な補助剤をあげることができ、これらの補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用し、又

ある場合には全く補助剤を使用しないことも可能である。

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

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

[0075] 固体製品の流動性改良のために次に挙げる補助剤を使用することもでき、例えばワックス、ステアリン酸塩、燐酸アルキルエステル等の補助剤を使用できる。懸濁性製品の解こう剤として、例えばナフトレンスルホン酸縮合物、縮合燐酸塩等の補助剤を使用することもできる。

消泡剤としては、例えばシリコーン油等の補助剤を使用することもできる。

防腐剤としては、1, 2-ベンズイソチアゾリン-3-オン、パラクロロメタキシレノール、パラオキシ安息香酸ブチル等も添加することが出来る。

更に必要に応じて機能性展着剤、ピペロニルブトキサイド等の代謝分解阻害剤等の活性増強剤、プロピレングリコール等の凍結防止剤、BHT等の酸化防止剤、紫外線吸収剤等その他の添加剤も加えることが可能である。

[0076] 有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、農園芸用殺虫剤100重量部中、0.01~90重量部の範囲から適宜選択して使用すれば良く、例えば粉剤又は粒剤とする場合は0.01~50重量%、又乳剤又は水和剤とする場合も同様0.01~50重量%が適当である。

本発明の農園芸用薬剤は各種害虫を防除するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で害虫防除に有効な量を当該害虫の発生が予測され

る作物若しくは発生が好ましくない場所に適用して使用すれば良い。

本発明の農園芸用薬剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.001g~10kg、好ましくは0.01g~1kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

[0077] 本発明の農園芸用薬剤は、更に防除対象病虫害、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、生物農薬等と混合して使用することも可能であり、又、使用場面に応じて除草剤、植物成長調節剤、肥料等と混合して使用することも可能である。

かかる目的で使用する他の農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤としては、例えばエチオン、トリクロルホン、メタミドホス、アセフェート、ジクロルボス、メビンホス、モノクロトホス、マラチオン、ジメトエート、ホルモチオン、メカルバム、バミドチオン、チオメトン、ジスルホトン、オキシデプロホス、ナレド、メチルパラチオン、フェニトロチオン、シアノホス、プロパホス、フェンチオン、プロチオホス、プロフェノホス、イソフェンホス、テメホス、フェントエート、ジメチルビンホス、クロルフェビンホス、テトラクロルビンホス、ホキシム、イソキサチオン、ピラクロホス、メチダチオン、クロロピリホス、クロルピリホス・メチル、ピリダフェンチオン、ダイアジノン、ピリミホスメチル、ホサロン、ホスメット、ジオキサベンゾホス、キナルホス、テルブホス、エトプロホス、カズサホス、メスルフェンホス、DPS(NK-0795)、

[0078] ホスホカルブ、フェナミホス、イソアミドホス、ホスチアゼート、イサゾホス、エナプロホス、フェンチオン、ホスチエタン、ジクロフェンチオン、チオナジン、スルプロホス、フェンスルフォチオン、ジアミダホス、ピレトリン、アレスリン、プラレトリン、レスメトリン、ペルメトリン、テフルトリン、ビフェントリン、フェンプロパトリン、シペルメトリン、アルファシペルメトリン、シハロトリン、ラムダシハロトリン、デルタメトリン、アクリナトリン、フェンバレレート、エスフェンバレレート、シクロプロトリン、エトフェンプロックス、ハルフェンプロックス、シラフルオフェン、フルシトリネート、フルバリネート、メソミル、オキサミル、チオジカルブ、アルジカルブ、アラニカルブ、カルタップ、メトルカルブ、キシリカルブ、プロポキスル、フェノキシカルブ、フェノブカルブ、エチオフェンカルブ、フェノチオカルブ、

ビフェナゼート、BPMC、カルバリル、ピリミカーブ、カルボフラン、カルボスルファン、フラチオカルブ、ベンフラカルブ、アルドキシカルブ、ジアフェンチウロン、ジフルベンズロン、テフルベンズロン、ヘキサフルムロン、ノバルロン、ルフェヌロン、フルフェノクスロン、クロルフルアズロン、酸化フェンブタスズ、水酸化トリシクロヘキシルスズ、オレイン酸ナトリウム、オレイン酸カリウム、メブレン、ハイドロブレン、ビナパクリル、アミトラス、ジコホル、ケルセン、クロルベンジレート、フェニソプロモレート、テトラジホン、ベンスルタップ、ベンゾメート、テブフェノジド、メキシフェノジド、ピリダリル、

[0079] クロマフェノジド、プロパルギット、アセキノシル、エンドスルファン、ジオフェノラン、クロルフェナピル、フェンピロキシメート、トルフェンピラド、フィプロニル、テブフェンピラド、トリアザメート、エトキサゾール、ヘキシチアゾクス、硫酸ニコチン、ニテンピラム、アセタミプリド、チアクロプリド、イミダクロプリド、チアメキサム、クロチアニジン、ジノテフラン、フルアジナム、ピリプロキシフェン、ヒドラメチルノン、ピリミジフェン、ピリダベン、シロマジン、TPIC (トリプロピルイソシアヌレート)、ピメトロジン、クロフェンテジン、ブプロフェジン、チオシクラム、フェナザキン、キノメチオネート、インドキサカルブ、ポリナクチン複合体、ミルベメクチン、アバメクチン、エマメクチン・ベンゾエート、スピノサッド、BT (バチルス・チューリンゲンシス)、アザディラクチン、ロテノン、ヒドロキシプロピルデンブン、塩酸レバミゾール、メタム・ナトリウム、酒石酸モランテル、ダゾメット、トリクラミド、バストリア、モナクロスポリウム・フィマトパガム等の農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤を例示することができ、

[0080] 同様の目的で使用する農園芸用殺菌剤としては、例えば硫黄、石灰硫黄合剤、塩基性硫酸銅、イプロベンホス、エディフェンホス、トルクロホス・メチル、チラム、ポリカーバメイト、ジネブ、マンゼブ、マンコゼブ、プロピネブ、チオフアネート、チオフアネートメチル、ベノミル、イミノクタジン酢酸塩、イミノクタジンアルベシル酸塩、メプロニル、フルトラニル、ペンシクロン、フラメトピル、チフルザミド、メタラキシル、オキサジキシル、カルプロパミド、ジクロフルアニド、フルスルファミド、クロロタロニル、クレソキシム・メチル、フェノキサニル、ヒメキサゾール、エクロメゾール、フルオルイミド、プロシミドン、ビシクロゾリン、イプロジオン、トリアジメホン、ビテルタノール、トリフルミゾール、イプコナゾール、フルコナゾール、プロピコナゾール、ジフェノコナゾール、マイクロブタニル、テト

ラコナゾール、ヘキサコナゾール、テブコナゾール、チアジニル、イミベンコナゾール、プロクロラズ、ペフラゾエート、シプロコナゾール、イソプロチオラン、フェナリモル、ピリメタニル、メパニピリム、ピリフェノックス、フルアジナム、トリホリン、ジクロメジン、アゾキシストロビン、チアジアジン、キャプタン、プロベナゾール、アシベンゾフラールSメチル、フサライド、トリシクラゾール、ピロキロン、キノメチオネート、オキシリニック酸、ジチアノン、カスガマイシン、バリダマイシン、ポリオキシシン、ブラストサイジン、ストレプトマイシン等の農園芸用殺菌剤を例示することができる、

[0081] 同様に除草剤としては、例えばグリホサート、スルホセート、グルホシネート、ビアラホス、ブタミホス、エスプロカルブ、プロスルホカルブ、ベンチオカーブ、ピリブチカルブ、アシュラム、リニューロン、ダイムロン、イソウロン、ベンスルフロメチル、シクロスルファミロン、シノスルフロメチル、ピラゾスルフロメチル、アジメスルフロメチル、イマゾスルフロメチル、テニルクロール、アラクロール、プレチラクロール、クロメプロップ、エトベンザニド、メフェナセート、ペンディメタリン、ビフェノックス、アシフルオフェン、ラクトフェン、シハロホップブチル、アイオキシニル、プロモブチド、アロキシジム、セトキシジム、ナプロパミド、インダノファン、ピラゾレート、ベンゾフェナップ、ピラフルフェンエチル、イマザピル、スルフェントラゾン、カフェンストロール、ベントキサゾン、オキサジアゾン、パラコート、ジクワット、ピリミノバック、シマジン、アトラジン、ジメタメトリン、トリアジフラム、ベンフレセート、フルチアセットメチル、キザロホップ・エチル、ベントキサゾン、過酸化カルシウム等の除草剤を例示することができる。

[0082] 又、生物農薬として、例えば核多角体ウイルス(Nuclear polyhedrosis virus、NPV)、顆粒病ウイルス(Granulosis virus、GV)、細胞質多角体病ウイルス(Cytoplasmic polyhedrosis virus、CPV)、昆虫ポックスウイルス(Entomopox virus、EPV)等のウイルス製剤、モノクロスボリウム・フィマトパガム(Monacrosporium phymatophagum)、スタイナーネマ・カーポカプサエ(Steinernema carpocapsae)、スタイナーネマ・クシダエ(Steinernema kushidai)、パスツーリア・ペネトランス(Pasteuria penetrans)等の殺虫又は殺線虫剤として利用される微生物農薬、トリコデルマ・リグノラン(Trichoderma lignorum)、アグロバクテリウム・ラジオブクター(Agrobacterium radiobacter)、非病原性エルビニア・カトボーラ(Erwinia carotovora)、バチルス・ズブチリス(Bacillus subtilis)等

の殺菌剤として使用される微生物農薬、ザントモナス・キャンペストリス(*Xanthomonas campestris*)等の除草剤として利用される生物農薬などと混合して使用することにより、同様の効果が期待できる。

- [0083] 更に、生物農薬として例えばオンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*)、コレマンアブラバチ (*Aphidius colemani*)、シヨクガタマバエ (*Aphidoletes aphidimyza*)、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*)、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*)、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*)、ククメリスカブリダニ (*Amblyseius cucumeris*)、ナミヒメハナカメムシ (*Orius sauteri*)等の天敵生物、ボーベリア・ブロンニアティ (*Beauveria brongniartii*)等の微生物農薬、(Z)-10-テトラデセニル=アセタート、(E, Z)-4, 10-テトラデカジニエル=アセタート、(Z)-8-ドデセニル=アセタート、(Z)-11-テトラデセニル=アセタート、(Z)-13-イコセン-10-オン、14-メチル-1-オクタデセン等のフェロモン剤と併用することも可能である。

実施例

- [0084] 以下に本発明の一般式(I)で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体について、実施例を挙げて説明するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

実施例1. N-{3-イソブチル-4-[1-メキシ-2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}-2-メチルピリジン-3-カルボン酸アミド(化合物No. 1-25)の製造

2-メチル-3-ピリジンカルボン酸(136mg, 1ミリモル)、3-イソブチル-4-[1-メキシ-2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリン(329mg, 1ミリモル)、2-クロロ-1-メチルピリジニウムヨード(255mg, 1ミリモル)、及びトリエチルアミン(303mg, 3ミリモル)をテトラヒドロフラン(10mL)に溶解し、3時間加熱還流した。反応液を酢酸エチルで希釈後、水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=1:2)にて精製することにより目的物(100mg)を結晶として得た。

収率:22%

物性:融点 174-175°C

[0085] 実施例2. N-プロピオニル-N-{3-イソブチル-4-[1-メトキシ-2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}-2-メチルピリジン-3-カルボン酸アミド(化合物No. 1-42)の製造

水素化ナトリウム(純度62%オイルディスパーズ品, 16mg, 0.4ミリモル)を無水テトラヒドロフラン(3mL)中で攪拌しながら、室温下にN-{3-イソブチル-4-[1-メトキシ-2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}-2-メチルピリジン-3-カルボン酸アミドの無水テトラヒドロフラン(3mL)溶液を滴下した。30°Cで30分間攪拌した後、同温度下でプロピオニルクロライド(0.034g, 0.36ミリモル)の無水テトラヒドロフラン(0.5mL)溶液を滴下した。30°Cで15分間、引き続き50°Cで45分間攪拌反応した。冷却後、反応液に水(30mL)を加えて酢酸エチルで抽出した。水洗、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=1:2)にて精製することによりペースト状の目的物(116mg)を得た。

収率:62%

物性:屈折率1.4990(23.6°C)

[0086] 実施例3. N-イソプロポキシメチル-N-{3-イソブチル-4-[1-メトキシ-2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}-2-メチルピリジン-3-カルボン酸アミド(化合物No. 1-40)の製造

水素化ナトリウム(純度62%オイルディスパーズ品, 16mg, 0.4ミリモル)を無水テトラヒドロフラン(3mL)中で攪拌しながら、室温下にN-{3-イソブチル-4-[1-メトキシ-2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}-2-メチルピリジン-3-カルボン酸アミド(0.15g, 0.33ミリモル)の無水テトラヒドロフラン(3mL)溶液を滴下した。30°Cで30分間攪拌した後、同温度下でクロロメチルイソプロピルエーテル(0.05g, 0.54ミリモル)の無水テトラヒドロフラン(0.5mL)溶液を、次いでジメチルホルムアミド(0.3mL)を滴下した。30°Cで30分間、引き続き50°Cで2時間攪拌反応した。冷却後、反応液に水(30mL)を加えて酢酸エチル抽出した。水洗、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=1:2)にて精製することによりペ

一スト状の目的物(155mg)を得た。

収率:89%

物性:屈折率1.4931(23.3°C)

[0087] 以下に本発明の代表的な製剤例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

尚、製剤例中、部とあるのは重量部を示す。

製剤例1

第1表記載の化合物	10部
キシレン	70部
N-メチルピロリドン	10部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	10部

以上を均一に混合溶解して乳剤とする。

[0088] 製剤例2

第1表記載の化合物	3部
クレー粉末	82部
珪藻土粉末	15部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。

[0089] 製剤例3

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

以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。

[0090] 製剤例4

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

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

[0091] 試験例1 ナミハダニ (*Tetranychus urticae*) に対する殺ダニ試験

直径2cmのインゲン葉リーフディスクを湿潤濾紙上に置いた。そこへ10頭のナミハダニ雌成虫を接種した後、第1表に記載の化合物を有効成分とする製剤を500ppm及び50ppmに希釈した薬液50mlを散布した。処理2日後に生存数を調査した。下記式により補正死虫率を算出し、下記の判定基準に従って判定した。25°C条件下、2連制。

[0092] [数1]

$$\text{補正死虫率 (\%)} = \frac{\text{無処理区生存数} - \text{処理区生存数}}{\text{無処理区生存数}} \times 100$$

[0093] 判定基準: A・・・補正死虫率100%

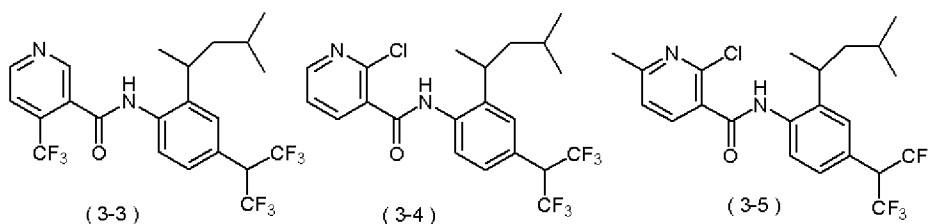
B・・・補正死虫率99%~90%

C・・・補正死虫率89%~80%

D・・・補正死虫率79%~50%

[0094] 尚、比較化合物として、特開2003-48878号公報記載の化合物No. 3-3~5を用いた。

[0095] [化6]



[0096] 上記試験の結果、本発明の化合物No. 1-8~1-11、1-22、1-25、1-28、1-30~33、1-35、1-37~59、1-61~78、1-80、1-82、1-89及び1-90の化合物は500ppm及び50ppmいずれの濃度においてもA活性を示した。一方、対照の3化合物とも500ppmの濃度でも殺ダニ活性を示さなかった。

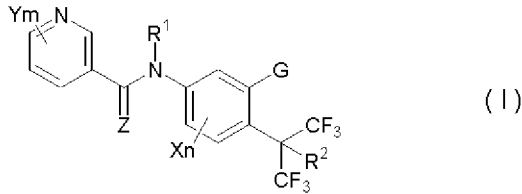
本出願は、日本で出願された特願2006-276895を基礎としており、その内容は

、本明細書にすべて包含されるものである。

請求の範囲

[1] 一般式(I)

[化1]

{式中、R¹は

(1a) 水素原子、

(2a) C₁₋₆-C₁₋₆ アルキル基、(3a) ハロC₁₋₆-C₁₋₆ アルキル基、(4a) C₁₋₆-C₁₋₆ アルキルカルボニルC₁₋₆-C₁₋₆ アルキル基、(5a) C₃₋₆-C₃₋₆ シクロアルキル基、(6a) ハロC₃₋₆-C₃₋₆ シクロアルキル基、(7a) C₃₋₆-C₃₋₆ シクロアルキルC₁₋₆-C₁₋₆ アルキル基、(8a) ハロC₃₋₆-C₃₋₆ シクロアルキルC₁₋₆-C₁₋₆ アルキル基、(9a) C₂₋₆-C₂₋₆ アルケニル基、(10a) ハロC₂₋₆-C₂₋₆ アルケニル基、(11a) C₂₋₆-C₂₋₆ アルキニル基、(12a) ハロC₂₋₆-C₂₋₆ アルキニル基、(13a) C₁₋₆-C₁₋₆ アルコキシC₁₋₆-C₁₋₆ アルキル基、(14a) ハロC₁₋₆-C₁₋₆ アルコキシC₁₋₆-C₁₋₆ アルキル基、(15a) C₁₋₆-C₁₋₆ アルコキシC₁₋₆-C₁₋₆ アルコキシC₁₋₆-C₁₋₆ アルキル基、(16a) C₁₋₆-C₁₋₆ アルキルチオC₁₋₆-C₁₋₆ アルキル基、(17a) ハロC₁₋₆-C₁₋₆ アルキルチオC₁₋₆-C₁₋₆ アルキル基、(18a) C₁₋₆-C₁₋₆ アルキルスルフィニルC₁₋₆-C₁₋₆ アルキル基、(19a) ハロC₁₋₆-C₁₋₆ アルキルスルフィニルC₁₋₆-C₁₋₆ アルキル基、(20a) C₁₋₆-C₁₋₆ アルキルスルホニルC₁₋₆-C₁₋₆ アルキル基、(21a) ハロC₁₋₆-C₁₋₆ アルキルスルホニルC₁₋₆-C₁₋₆ アルキル基、

- (22a) $\text{モノC}_1\text{-C}_6$ アルキルアミノ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル基、
- (23a) 同一又は異なっても良い $\text{ジC}_1\text{-C}_6$ アルキルアミノ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル基、
- (24a) フェニル $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルコキシ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル基、
- (25a) $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルカルボニル基、
- (26a) ハロ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルカルボニル基、
- (27a) $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルコキシ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルカルボニル基、
- (28a) $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルコキシカルボニル基、
- (29a) $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルコキシ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルコキシカルボニル基、
- (30a) ハロ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルコキシカルボニル基、
- (31a) $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルチオカルボニル基、
- (32a) $\text{モノC}_1\text{-C}_6$ アルキルアミノカルボニル基、
- (33a) 同一又は異なっても良い $\text{ジC}_1\text{-C}_6$ アルキルアミノカルボニル基、
- (34a) $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルコキシカルボニル $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル基、
- (35a) $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルスルホニル基、
- (36a) ハロ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルスルホニル基、
- (37a) シアノ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル基、
- (38a) フェニル $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル基、
- (39a) 同一又は異なっても良く、
- (a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル基、(e) ハロ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル基、(f) $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルコキシ基、(g) ハロ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルコキシ基、(h) $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルチオ基、(i) ハロ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルチオ基、(j) $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルスルフィニル基、(k) ハロ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルスルフィニル基、(l) $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルスルホニル基、(m) ハロ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルスルホニル基、(n) $\text{モノC}_1\text{-C}_6$ アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良い $\text{ジC}_1\text{-C}_6$ アルキルアミノ基、及び(p) $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルコキシカルボニル基
- から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル基、
- (40a) フェノキシカルボニル基、
- (41a) 同一又は異なっても良く、
- (a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル基、(e) ハロ $\text{C}_1\text{-C}_6$ ア

ルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェノキシカルボニル基、

(42a) フェニルスルホニル基、

(43a) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルスルホニル基、

(44a) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルホスホノ基、

(45a) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルホスホノチオ基、

(46a) $N-C_1-C_6$ アルキル- $N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニルアミノチオ基、

(47a) $N-C_1-C_6$ アルキル- $N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニル C_1-C_6 アルキルアミノチオ基

(48a) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノチオ基、

(49a) C_3-C_6 シクロアルキルカルボニル基、

(50a) C_1-C_6 アルキル C_3-C_6 シクロアルキルカルボニル基、

(51a) フェニル C_3-C_6 シクロアルキルカルボニル基、

(52a) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6

アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基をフェニル環上に有する置換フェニル C_3-C_6 シクロアルキルカルボニル基、

(53a) C_2-C_6 アルケニルオキシカルボニル基、

(54a) フェニル C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、

(55a) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、

(56a) フェニル C_1-C_6 アルキルカルボニル基、又は

(57a) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1-C_6 アルキルカルボニル基

を示す。

R^2 は

- (1b) 水素原子、
- (2b) ハロゲン原子、
- (3b) C_1-C_6 アルキル基、
- (4b) ハロ C_1-C_6 アルキル基、
- (5b) シアノ基、
- (6b) ヒドロキシ基、
- (7b) C_1-C_6 アルコキシ基、
- (8b) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、
- (9b) C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_3 アルコキシ基、
- (10b) ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_3 アルコキシ基、
- (11b) C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_3 アルコキシ基、
- (12b) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_3 アルコキシ基、
- (13b) C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_3 アルコキシ基、
- (14b) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_3 アルコキシ基、
- (15b) C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_3 アルコキシ基、
- (16b) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_3 アルコキシ基、
- (17b) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_3 アルコキシ基、
- (18b) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_3 アルコキシ基、
- (19b) C_1-C_6 アルキルチオ基、
- (20b) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、
- (21b) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、
- (22b) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、
- (23b) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、
- (24b) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、
- (25b) アミノ基、
- (26b) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、
- (27b) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、
- (28b) フェノキシ基、

(29b) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェノキシ基、

(30b) フェニルチオ基、

(31b) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルチオ基、

(32b) フェニルスルフィニル基、

(33b) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルスルフィニル基、

(34b) フェニルスルホニル基、

(35b) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルスルホニル基、

(36b) フェニル C_1-C_6 アルコキシ基、又は

(37b) 同一若しくは異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1-C_6 アルコキシ基を示す。

Gは

(1c) C_1-C_{10} アルキル基、

(2c) ハロ C_1-C_{10} アルキル基、

(3c) C_3-C_{10} アルケニル基、

(4c) ハロ C_3-C_{10} アルケニル基、

(5c) C_3-C_{10} アルキニル基、

(6c) ハロ C_3-C_{10} アルキニル基、

(7c) C_3-C_{10} シクロアルキル基、

(8c) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) C_1-C_6 アルキル基、及び(c) ハロ C_1-C_6 アルキル基

から選択される1以上の置換基を有する置換 C_3-C_{10} シクロアルキル基、

(9c) C_3-C_{10} シクロアルケニル基、

(10c) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) C_1-C_6 アルキル基、及び(c) ハロ C_1-C_6 アルキル基から選択される1以上の置換基を有する置換 C_3-C_{10} シクロアルケニル基、

(11c) C_3-C_8 シクロアルキル C_1-C_6 アルキル基、又は

(12c) ハロ C_3-C_8 シクロアルキル C_1-C_6 アルキル基

を示す。

Zは酸素原子又は硫黄原子を示す。

nは0～3の整数を示す。

Xは同一又は異なっても良く、

(1d) ハロゲン原子、

(2d) シアノ基、

(3d) ニトロ基、

(4d) C_1-C_6 アルキル基、又は

(5d) ハロ C_1-C_6 アルキル基

を示す。

mは0～4の整数を示す。

Yは同一又は異なっても良く、

(1e) ハロゲン原子、

(2e) シアノ基、

(3e) ニトロ基、

(4e) 水酸基、

(5e) メルカプト基、

(6e) アミノ基、

(7e) カルボキシ基、

(8e) C_1-C_6 アルキル基、

(9e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、

(10e) C_2-C_6 アルケニル基、

- (11e) ハロC₂-C₆ アルケニル基、
- (12e) C₂-C₆ アルキニル基、
- (13e) ハロC₂-C₆ アルキニル基、
- (14e) 同一又は異なっても良いトリC₁-C₆ アルキルシリルC₂-C₆ アルキニル基、
- (15e) フェニルC₂-C₆ アルキニル基、
- (16e) C₁-C₆ アルコキシC₁-C₆ アルコキシC₁-C₆ アルキル基、
- (17e) ヒドロキシC₁-C₆ アルキル基、
- (18e) C₁-C₆ アルキルカルボニルオキシC₁-C₆ アルキル基、
- (19e) C₃-C₆ シクロアルキル基、
- (20e) ハロC₃-C₆ シクロアルキル基、
- (21e) C₃-C₆ シクロアルキルC₁-C₆ アルキル基、
- (22e) ハロC₃-C₆ シクロアルキル C₁-C₆ アルキル基、
- (23e) C₁-C₆ アルコキシ基、
- (24e) ハロC₁-C₆ アルコキシ基、
- (25e) C₁-C₆ アルコキシC₁-C₆ アルコキシ基、
- (26e) ハロC₁-C₆ アルコキシC₁-C₆ アルコキシ基、
- (27e) フェニルC₁-C₆ アルコキシ基、
- (28e) C₁-C₆ アルコキシC₁-C₆ アルキル基、
- (29e) ハロC₁-C₆ アルコキシC₁-C₆ アルキル基、
- (30e) C₁-C₆ アルキルチオ基、
- (31e) ハロC₁-C₆ アルキルチオ基、
- (32e) C₁-C₆ アルキルスルフィニル基、
- (33e) ハロC₁-C₆ アルキルスルフィニル基、
- (34e) C₁-C₆ アルキルスルホニル基、
- (35e) ハロC₁-C₆ アルキルスルホニル基、
- (36e) C₁-C₆ アルキルチオC₁-C₆ アルキル基、
- (37e) ハロC₁-C₆ アルキルチオC₁-C₆ アルキル基、
- (38e) C₁-C₆ アルキルスルフィニルC₁-C₆ アルキル基、

(39e) ハロC₁₋₆-C₁₋₆アルキルスルフィニルC₁₋₆-C₁₋₆アルキル基、

(40e) C₁₋₆-C₁₋₆アルキルスルホニルC₁₋₆-C₁₋₆アルキル基、

(41e) ハロC₁₋₆-C₁₋₆アルキルスルホニルC₁₋₆-C₁₋₆アルキル基、

(42e) モノC₁₋₆-C₁₋₆アルキルアミノ基、

(43e) 同一又は異なっても良いジC₁₋₆-C₁₋₆アルキルアミノ基、

(44e) フェニルアミノ基、

(45e) モノC₁₋₆-C₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆-C₁₋₆アルキル基、

(46e) 同一又は異なっても良いジC₁₋₆-C₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆-C₁₋₆アルキル基、

(47e) フェニル基、

(48e) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C₁₋₆-C₁₋₆アルキル基、(e) ハロC₁₋₆-C₁₋₆アルキル基、(f) C₁₋₆-C₁₋₆アルコキシ基、(g) ハロC₁₋₆-C₁₋₆アルコキシ基、(h) C₁₋₆-C₁₋₆アルキルチオ基、(i) ハロC₁₋₆-C₁₋₆アルキルチオ基、(j) C₁₋₆-C₁₋₆アルキルスルフィニル基、(k) ハロC₁₋₆-C₁₋₆アルキルスルフィニル基、(l) C₁₋₆-C₁₋₆アルキルスルホニル基、(m) ハロC₁₋₆-C₁₋₆アルキルスルホニル基、(n) モノC₁₋₆-C₁₋₆アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジC₁₋₆-C₁₋₆アルキルアミノ基、及び(p) C₁₋₆-C₁₋₆アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル基、

(49e) フェノキシ基、

(50e) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C₁₋₆-C₁₋₆アルキル基、(e) ハロC₁₋₆-C₁₋₆アルキル基、(f) C₁₋₆-C₁₋₆アルコキシ基、(g) ハロC₁₋₆-C₁₋₆アルコキシ基、(h) C₁₋₆-C₁₋₆アルキルチオ基、(i) ハロC₁₋₆-C₁₋₆アルキルチオ基、(j) C₁₋₆-C₁₋₆アルキルスルフィニル基、(k) ハロC₁₋₆-C₁₋₆アルキルスルフィニル基、(l) C₁₋₆-C₁₋₆アルキルスルホニル基、(m) ハロC₁₋₆-C₁₋₆アルキルスルホニル基、(n) モノC₁₋₆-C₁₋₆アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジC₁₋₆-C₁₋₆アルキルアミノ基、及び(p) C₁₋₆-C₁₋₆アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェノキシ基、

(51e) 複素環基、又は

(52e) 同一若しくは異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換複素環基

を示す。又は、

(53e) ピリジン環上の隣接した2個のYは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有することもできる。}

で表される置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体又はその塩類。

[2] R^1 が

(1a) 水素原子、

(2a) C_1-C_6 アルキル基、

(13a) C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、

(25a) C_1-C_6 アルキルカルボニル基、

(27a) C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキルカルボニル基、

(28a) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、

(37a) シアノ C_1-C_6 アルキル基、

(40a) フェノキシカルボニル基、

(41a) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェノキシカルボニル基、

(49a) C_3-C_6 シクロアルキルカルボニル基、

(50a) C_1-C_6 アルキル C_3-C_6 シクロアルキルカルボニル基、

(51a) フェニル C_3-C_6 シクロアルキルカルボニル基、

(52a) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基をフェニル環上に有する置換フェニル C_3-C_6 シクロアルキルカルボニル基、

(53a) C_2-C_6 アルケニルオキシカルボニル基、

(54a) フェニル C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、

(55a) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C_1-C_6 アルキル基、(e) ハロ C_1-C_6 アルキル基、(f) C_1-C_6 アルコキシ基、(g) ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、(h) C_1-C_6 アルキルチオ基、(i) ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、(j) C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(k) ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、(l) C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(m) ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、(n) モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、及び(p) C_1-C_6 アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC₁-C₆アルコキシカルボニル基、

(56a) フェニルC₁-C₆アルキルカルボニル基、又は

(57a) 同一又は異なっても良く、

(a) ハロゲン原子、(b) シアノ基、(c) ニトロ基、(d) C₁-C₆アルキル基、(e) ハロC₁-C₆アルキル基、(f) C₁-C₆アルコキシ基、(g) ハロC₁-C₆アルコキシ基、(h) C₁-C₆アルキルチオ基、(i) ハロC₁-C₆アルキルチオ基、(j) C₁-C₆アルキルスルフィニル基、(k) ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、(l) C₁-C₆アルキルスルホニル基、(m) ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、(n) モノC₁-C₆アルキルアミノ基、(o) 同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、及び(p) C₁-C₆アルコキシカルボニル基

から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC₁-C₆アルキルカルボニル基

である請求項1に記載の置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体又はその塩類。

[3] R²が

(1b) 水素原子、

(2b) ハロゲン原子、又は

(7b) C₁-C₆アルコキシ基

である請求項1又は2に記載の置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体又はその塩類。

[4] Gが(1c) C₁-C₁₀アルキル基である請求項1乃至3のいずれか1項に記載の置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体又はその塩類。

[5] nが0である請求項1乃至4のいずれか1項に記載の置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体及びその塩類。

[6] Zが酸素原子である請求項1乃至5のいずれか1項に記載の置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体及びその塩類。

[7] 請求項1乃至6のいずれか1項に記載の置換ピリジンカルボン酸アニリド誘導体又はその塩類を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用薬剤。

[8] 農園芸用殺虫剤又は殺ダニ剤である請求項7に記載の農園芸用薬剤。

- [9] 有用植物から有害生物を防除するために、請求項7又は8に記載の農園芸用薬剤の有効量を対象植物又は土壌に処理することを特徴とする農園芸用薬剤の使用方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2007/069778

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER C07D213/82(2006.01)i, A01N43/40(2006.01)i, A01P7/02(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i		
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) C07D213/00-213/90, A01N43/40, A01P7/02, A01P7/04		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched Jitsuyo Shinan Koho 1922-1996 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2007 Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-2007 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-2007		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) CPlus (STN), REGISTRY (STN)		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	JP 2003-48878 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 21 February, 2003 (21.02.03), Claims 1 to 7; tables 1 to 5; test example 3 & EP 1400516 A1 & US 2004/116744 A1 & WO 2002/096882 A1	1-9
Y	JP 2006-8675 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 12 January, 2006 (12.01.06), Claims 1 to 7; table 1; test example 1 & WO 2005/115994 A1 & EP 1757595 A1	1-9
A	JP 2004-189738 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 08 July, 2004 (08.07.04), Claims 1 to 9; table 8 (Family: none)	1-9
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C.		<input type="checkbox"/> See patent family annex.
* Special categories of cited documents:	"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	
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"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	
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date	"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	
"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)	"&" document member of the same patent family	
"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		
Date of the actual completion of the international search 04 December, 2007 (04.12.07)	Date of mailing of the international search report 18 December, 2007 (18.12.07)	
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office	Authorized officer	
Facsimile No.	Telephone No.	

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC)) Int.Cl. C07D213/82(2006.01)i, A01N43/40(2006.01)i, A01P7/02(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i		
B. 調査を行った分野 調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC)) Int.Cl. C07D213/00-213/90, A01N43/40, A01P7/02, A01P7/04		
最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの 日本国実用新案公報 1922-1996年 日本国公開実用新案公報 1971-2007年 日本国実用新案登録公報 1996-2007年 日本国登録実用新案公報 1994-2007年		
国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語) CAplus(STN), REGISTRY(STN)		
C. 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	JP 2003-48878 A (日本農薬株式会社) 2003.02.21, 請求項1-7, 第1-5表, 試験例3 & EP 1400516 A1 & US 2004/116744 A1 & WO 2002/096882 A1	1-9
Y	JP 2006-8675 A (日本農薬株式会社) 2006.01.12, 請求項1-7, 第1表, 試験例1 & WO 2005/115994 A1 & EP 1757595 A1	1-9
<input checked="" type="checkbox"/> C欄の続きにも文献が列挙されている。 <input type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。		
* 引用文献のカテゴリー 「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの 「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す) 「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願日の後に公表された文献 「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの 「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの 「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの 「&」 同一パテントファミリー文献		
国際調査を完了した日 04.12.2007	国際調査報告の発送日 18.12.2007	
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/J P) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 高岡 裕美 電話番号 03-3581-1101 内線 3492	4 P 3843

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	JP 2004-189738 A (日本農薬株式会社) 2004.07.08, 請求項1-9, 第8表 (ファミリーなし)	1-9