

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第5030945号
(P5030945)

(45) 発行日 平成24年9月19日(2012.9.19)

(24) 登録日 平成24年7月6日(2012.7.6)

(51) Int. Cl.		F I	
CO7D 239/30	(2006.01)	CO7D 239/30	CSP
CO7D 237/12	(2006.01)	CO7D 237/12	
CO7D 241/16	(2006.01)	CO7D 241/16	
AO1N 43/54	(2006.01)	AO1N 43/54	B
AO1N 43/58	(2006.01)	AO1N 43/58	A

請求項の数 6 (全 32 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2008-509426 (P2008-509426)	(73) 特許権者	507203353
(86) (22) 出願日	平成18年5月2日(2006.5.2)		バイエル・クroppサイエンス・アーゲー
(65) 公表番号	特表2008-540371 (P2008-540371A)		BAYER CROPPSCIENCE A
(43) 公表日	平成20年11月20日(2008.11.20)		G
(86) 国際出願番号	PCT/EP2006/061952		ドイツ国、40789・モンハイム、アル
(87) 国際公開番号	W02006/117356	(74) 代理人	100062007
(87) 国際公開日	平成18年11月9日(2006.11.9)		弁理士 川口 義雄
審査請求日	平成21年5月1日(2009.5.1)	(74) 代理人	100103920
(31) 優先権主張番号	05356075.1		弁理士 大崎 勝真
(32) 優先日	平成17年5月3日(2005.5.3)	(74) 代理人	100124855
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)		弁理士 坪倉 道明

最終頁に続く

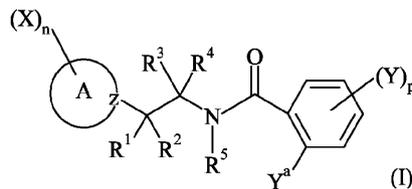
(54) 【発明の名称】 新規ヘテロシクリルエチルベンズアミド誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(I)

【化1】



〔式中、

- ・ n は、1 であり；
- ・ p は、1、2、3 又は 4 であり；
- ・ A は、同一であっても又は異なってもよい 1 個、2 個又は 3 個のヘテロ原子を有する 6 員非縮合ヘテロ環（但し、A は、ピリジル、ピペリジン及びピペラジンとは異なっている。）であって、ピリダジン、ピリミジン又はピラジンを表わし；
- ・ z は、炭素原子又はヘテロ原子（これらは、X により置換されることができない。）であり；
- ・ X は、同一であるか又は異なっていて、ハロゲン原子であり；
- ・ R¹ 及び R² は、同一であるか又は異なっていて、水素原子であり；

- ・ R^3 及び R^4 は、同一であるか又は異なっていて、水素原子であり；
- ・ R^5 は、水素原子であり；
- ・ Y は、同一であるか又は異なっていて、水素原子であり；及び、
- ・ Y^a は、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルキルである。

]

で表される化合物、又はその塩若しくは光学活性異性体。

【請求項 2】

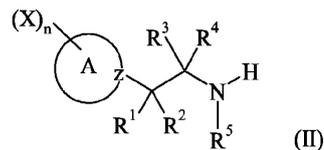
A がオルト位で置換されていることを特徴とする、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

請求項 1 又は 2 で定義されている一般式 (I) で表される化合物を調製する方法であり 10

一般式 (II)

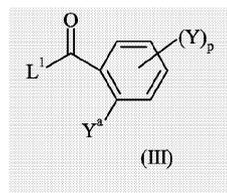
【化 2】



[式中、A、X、n、z、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 は、請求項 1 で定義されているとおりである。] 20

で表されるヘテロシクリルエチルアミン誘導体又はその塩のうちの 1 種類を、一般式 (III)

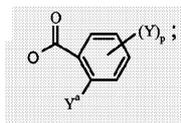
【化 3】



[式中、

- ・ Y^a 、 Y 及び p は、請求項 1 で定義されているとおりであり；
- ・ L^1 は、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $-OR^{2,3}$ 又は $-OCOR^{2,3}$ であるように選択される脱離基であり、ここで、 $R^{2,3}$ は、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、ベンジル、4 - メトキシベンジル、ペンタフルオロフェニル又は式

【化 4】



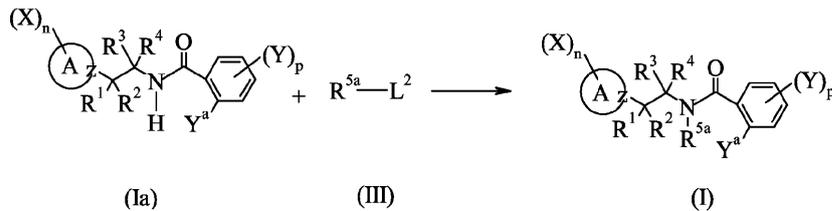
で表される基である。] 40

で表されるカルボン酸誘導体と、触媒の存在下で、および、 L^1 がヒドロキシ基である場合は、縮合剤の存在下で、反応させることを含む、前記方法。

【請求項 4】

R^5 が水素原子であり、および、前記調製方法が、一般式 (Ia) で表される化合物を一般式 (III) で表される化合物と反応させて一般式 (I) で表される化合物を生成させることを含む以下の反応スキーム：

【化5】



【ここで、

・ A、X、n、z、R¹、R²、R³、R⁴、Y^a、Y及びpは、請求項1で定義されているとおりであり；

・ R^{5a}は、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₇-シクロアルキルであり；

・ L²は、ハロゲン原子、4-メチルフェニルスルホニルオキシ又はメチルスルホニルオキシであるように選択される脱離基である。]

に従うさらなるステップにより完結されることを特徴とする、請求項3に記載の方法。

【請求項5】

有効量の請求項1又は2のいずれかに記載の化合物及び農業上許容される支持体を含む殺菌剤組成物。

【請求項6】

作物の植物病原性菌類と予防的又は治療的に闘う方法であり、有効でありおよび植物に対して毒性を示さない量の請求項5に記載の組成物を、植物の種子、又は、植物の葉及び/若しくは植物の果実、又は、植物がそこで生育している土壌若しくは植物をそこで栽培するのが望ましい土壌に施用することを特徴とする、前記方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規ヘテロシクリルエチルベンズアミド誘導体、それらを調製する方法、殺菌剤としてのそれらの使用、特に、殺菌剤組成物の形態における殺菌剤としてのそれらの使用、及び、それら化合物又はそれらの組成物を使用して植物の植物病原性菌類を防除する方法に関する。

【背景技術】

【0002】

国際特許出願WO01/11965には、2-ピリジル基が少なくとも1のハロゲンアルキル基で置換されている殺菌活性化合物の大きなファミリーが開示されている。この文献は、この文献が本発明のヘテロシクリルエチルベンズアミド誘導体を包含しているということについては全く開示していない。

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0003】

農業従事者によって使用されている活性成分に対する耐性株の発達を回避するか又はそれと闘うために、新規農薬活性化合物を使用することに関して、農薬分野においては常に高い関心が持たれている。

【課題を解決するための手段】

【0004】

本発明者らは、上記特徴を有する化合物の新規ファミリーを見いだした。

【0005】

従って、本発明は、一般式(I)

【0006】

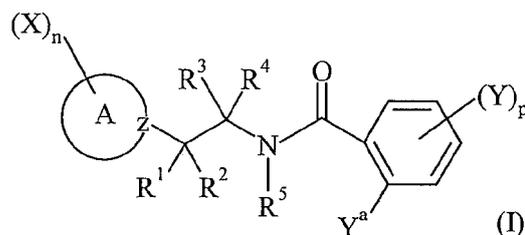
10

20

30

40

【化6】



[式中、

- ・ nは、1、2、3、4又は5であり；
- ・ pは、1、2、3又は4であり；
- ・ Aは、同一であっても又は異なってもよい1個、2個又は3個のヘテロ原子を有する6員非縮合ヘテロ環を表し（但し、Aは、ピリジル、ピペリジン及びピペラジンとは異なっている。）；
- ・ zは、炭素原子又はヘテロ原子（これらは、Xにより置換されることができない。）であり；
- ・ Xは、同一であるか又は異なっていて、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、ヒドロキシ基、アミノ基、スルファニル基、ペンタフルオロ-6-スルファニル基、ホルミル基、ホルミルオキシ基、ホルミルアミノ基、カルボキシ基、カルバモイル基、N-ヒドロキシカルバモイル基、カルバメート基、（ヒドロキシイミノ）-C₁-C₆-アルキル基、C₁-C₈-アルキル、C₂-C₈-アルケニル、C₂-C₈-アルキニル、C₁-C₈-アルキルアミノ、1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₈-ハロゲノアルキル、ジ-C₁-C₈-アルキルアミノ、C₁-C₈-アルコキシ、1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₈-ハロゲノアルコキシ、C₁-C₈-アルキルスルファニル、1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₈-ハロゲノアルキルスルファニル、C₂-C₈-アルケニルオキシ、1~5個のハロゲン原子を有するC₂-C₈-ハロゲノアルケニルオキシ、C₃-C₈-アルキニルオキシ、1~5個のハロゲン原子を有するC₃-C₈-ハロゲノアルキニルオキシ、C₃-C₈-シクロアルキル、1~5個のハロゲン原子を有するC₃-C₈-ハロゲノシクロアルキル、C₁-C₈-アルキルカルボニル、1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₈-ハロゲノアルキルカルボニル、C₁-C₈-アルキルカルバモイル、ジ-C₁-C₈-アルキルカルバモイル、N-C₁-C₈-アルキルオキシカルバモイル、C₁-C₈-アルコキシカルバモイル、N-C₁-C₈-アルキル-C₁-C₈-アルコキシカルバモイル、C₁-C₈-アルコキシカルボニル、1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₈-ハロゲノアルコキシカルボニル、C₁-C₈-アルキルカルボニルオキシ、1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₈-ハロゲノアルキルカルボニルオキシ、C₁-C₈-アルキルカルボニルアミノ、1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₈-ハロゲノアルキルカルボニルアミノ、C₁-C₈-アルキルアミノカルボニルオキシ、ジ-C₁-C₈-アルキルアミノカルボニルオキシ、C₁-C₈-アルキルオキシカルボニルオキシ、C₁-C₈-アルキルスルフェニル、1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₈-ハロゲノアルキルスルフェニル、C₁-C₈-アルキルスルフィニル、1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₈-ハロゲノアルキルスルフィニル、C₁-C₈-アルキルスルホニル、1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₈-ハロゲノアルキルスルホニル、C₁-C₆-アルコキシイミノ、（C₁-C₆-アルコキシイミノ）-C₁-C₆-アルキル、（C₁-C₆-アルケニルオキシイミノ）-C₁-C₆-アルキル、（C₁-C₆-アルキニルオキシイミノ）-C₁-C₆-アルキル、（ベンジルオキシイミノ）-C₁-C₆-アルキル、ベンジルオキシ、ベンジルスルファニル、ベンジルアミノ、フェノキシ、フェニルスルファニル、フェニル又はフェニルアミノであり；
- ・ R¹及びR²は、同一であるか又は異なっていて、水素原子、水素原子、シアノ基、ホルミル基、カルボキシ基、カルバモイル基、（ヒドロキシイミノ）-C₁-C₆-アルキル基、C₁-C₈-アルキル、C₃-C₇-シクロアルキル-C₁-C₈-アルキル

10

20

30

40

50

、 $C_2 - C_8$ - アルケニル、 $C_2 - C_8$ - アルキニル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_3 - C_8$ - ハロゲノシクロアルキル、 $C_1 - C_8$ - アルキルカルボニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルキルカルボニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_8$ - アルキルカルバモイル、ジ - $C_1 - C_8$ - アルキルカルバモイル、 $C_1 - C_8$ - アルコキシカルバモイル、 $C_1 - C_8$ - アルコキシカルボニル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルコキシカルボニルであり；

・ R^3 及び R^4 は、同一であるか又は異なっていて、水素原子、シアノ基、ホルミル基、カルボキシ基、カルバモイル基、(ヒドロキシイミノ) - $C_1 - C_6$ - アルキル基、 $C_1 - C_8$ - アルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル - $C_1 - C_8$ - アルキル、 $C_2 - C_8$ - アルケニル、 $C_2 - C_8$ - アルキニル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_3 - C_8$ - ハロゲノシクロアルキル、 $C_1 - C_8$ - アルキルカルボニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルキルカルボニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_8$ - アルキルカルバモイル、ジ - $C_1 - C_8$ - アルキルカルバモイル、 $C_1 - C_8$ - アルコキシカルバモイル、 $C_1 - C_8$ - アルコキシカルボニル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルコキシカルボニルであり；

・ R^5 は、水素原子、 $C_1 - C_6$ - アルキル又は $C_3 - C_7$ - シクロアルキルであり；

・ Y は、同一であるか又は異なっていて、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、ヒドロキシ基、アミノ基、スルファニル基、ペンタフルオロ - 6 - スルファニル基、ホルミル基、ホルミルオキシ基、ホルミルアミノ基、カルボキシ基、カルバモイル基、N - ヒドロキシカルバモイル基、カルバメート基、(ヒドロキシイミノ) - $C_1 - C_6$ - アルキル基、 $C_1 - C_8$ - アルキル、 $C_2 - C_8$ - アルケニル、 $C_2 - C_8$ - アルキニル、 $C_1 - C_8$ - アルコキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_8$ - アルキルスルファニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルキルスルファニル、 $C_2 - C_8$ - アルケニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_2 - C_8$ - ハロゲノアルケニルオキシ、 $C_3 - C_8$ - アルキニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_3 - C_8$ - ハロゲノアルキニルオキシ、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_3 - C_8$ - ハロゲノシクロアルキル、 $C_1 - C_8$ - アルキルカルボニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルキルカルボニル、 $C_1 - C_8$ - アルキルカルバモイル、ジ - $C_1 - C_8$ - アルキルカルバモイル、N - $C_1 - C_8$ - アルキルオキシカルバモイル、 $C_1 - C_8$ - アルコキシカルバモイル、N - $C_1 - C_8$ - アルキル - $C_1 - C_8$ - アルコキシカルバモイル、 $C_1 - C_8$ - アルコキシカルボニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルコキシカルボニル、 $C_1 - C_8$ - アルキルカルボニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルキルカルボニルオキシ、 $C_1 - C_8$ - アルキルカルボニルアミノ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルキルカルボニルアミノ、 $C_1 - C_8$ - アルキルアミノカルボニルオキシ、ジ - $C_1 - C_8$ - アルキルアミノカルボニルオキシ、 $C_1 - C_8$ - アルキルオキシカルボニルオキシ、 $C_1 - C_8$ - アルキルスルフェニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルキルスルフェニル、 $C_1 - C_8$ - アルキルスルフィニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_8$ - アルキルスルホニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシイミノ、($C_1 - C_6$ - アルコキシイミノ) - $C_1 - C_6$ - アルキル、($C_1 - C_6$ - アルケニルオキシイミノ) - $C_1 - C_6$ - アルキル、($C_1 - C_6$ - アルキニルオキシイミノ) - $C_1 - C_6$ - アルキル又は(ベンジルオキシイミノ) - $C_1 - C_6$ - アルキルであり；及び、

・ Y^a は、ハロゲン原子、シアノ基、スルファニル基、ペンタフルオロ - 6 - スルファニル基、ホルミル基、ホルミルオキシ基、ホルミルアミノ基、カルバモイル基、N -

10

20

30

40

50

ヒドロキシカルバモイル基、カルバメート基、(ヒドロキシイミノ) - C₁ - C₆ - アルキル基、C₁ - C₈ - アルキル、C₂ - C₈ - アルケニル、C₂ - C₈ - アルキニル、C₁ - C₈ - アルコキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₈ - ハロゲノアルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₈ - ハロゲノアルコキシ、C₁ - C₈ - アルキルスルファニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルスルファニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₂ - C₈ - ハロゲノアルケニルオキシ、C₃ - C₈ - アルキニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₃ - C₈ - ハロゲノアルキニルオキシ、C₃ - C₈ - シクロアルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₃ - C₈ - ハロゲノシクロアルキル、C₁ - C₈ - アルキルカルボニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルカルボニル、C₁ - C₈ - アルキルカルバモイル、ジ - C₁ - C₈ - アルキルカルバモイル、N - C₁ - C₈ - アルキルオキシカルバモイル、C₁ - C₈ - アルコキシカルバモイル、N - C₁ - C₈ - アルキル - C₁ - C₈ - アルコキシカルバモイル、C₁ - C₈ - アルコキシカルボニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₈ - ハロゲノアルコキシカルボニル、C₁ - C₈ - アルキルカルボニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルカルボニルオキシ、C₁ - C₈ - アルキルカルボニルアミノ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルカルボニルアミノ、C₁ - C₈ - アルキルアミノカルボニルオキシ、ジ - C₁ - C₈ - アルキルアミノカルボニルオキシ、C₁ - C₈ - アルキルオキシカルボニルオキシ、C₁ - C₈ - アルキルスルフェニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルスルフェニル、C₁ - C₈ - アルキルスルフィニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルスルフィニル、C₁ - C₈ - アルキルスルホニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルスルホニル、C₁ - C₆ - アルコキシイミノ、(C₁ - C₆ - アルコキシイミノ) - C₁ - C₆ - アルキル、(C₁ - C₆ - アルケニルオキシイミノ) - C₁ - C₆ - アルキル、(C₁ - C₆ - アルキニルオキシイミノ) - C₁ - C₆ - アルキル又は(ベンジルオキシイミノ) - C₁ - C₆ - アルキルである。]

で表されるヘテロシクリルエチルベンズアミド誘導体、並びに、その塩、N - オキシド、金属錯体、半金属錯体及び光学活性異性体に関する。

【発明を実施するための最良の形態】

【0007】

本発明に関連して：

- ・ ハロゲンは、フッ素、臭素、塩素又はヨウ素を意味する；
- ・ カルボキシは、-C(=O)OHを意味し、カルボニルは、-C(=O)-を意味し、カルバモイルは、-C(=O)NH₂を意味し、N - ヒドロキシカルバモイルは、-C(=O)NHOHを意味する；
- ・ アルキル基、アルケニル基及びアルキニル基、並びに、これらの用語を含んでいる部分構造は、直鎖又は分枝鎖であることができる；及び、
- ・ ヘテロ原子は、硫黄、窒素又は酸素を意味する。

【0008】

本発明に関連して、2置換されているアミノラジカル及び2置換されているカルバモイルラジカルの場合、当該2つの置換基がそれらを担持している窒素原子と一緒に3 ~ 7 個の原子を含んでいる飽和ヘテロ環を形成し得るということも、理解されなくてはならない。

【0009】

本発明の化合物はいずれも、その化合物内の不斉中心の数に応じて、1種類以上の光学異性体形態又はキラル異性体形態で存在し得る。かくして、本発明は、等しく、全ての光学異性体及びそれらのラセミ混合物又はスケールミック混合物(用語「スケールミック(scalemic)」は、異なった比率のエナンチオマーの混合物を意味する。)、並びに、可能な全ての立体異性体の全ての比率における混合物に関する。当業者は、自体公知の方法により、ジアステレオ異性体及び/又は光学異性体を分離させることができる。

【 0 0 1 0 】

本発明の化合物はいずれも、その化合物内の二重結合の数に応じて、1種類以上の幾何異性体形態でも存在し得る。かくして、本発明は、等しく、全ての幾何異性体及び全ての比率における可能な全ての混合物に関する。当業者は、自体公知の一般的な方法により、幾何異性体を分離させることができる。

【 0 0 1 1 】

一般式 (I) [式中、X は、ヒドロキシ、スルファニル基又はアミノ基を表す。] で表される化合物は、いずれも、当該ヒドロキシ基、スルファニル基又はアミノ基のプロトンのシフトの結果として、その互変異性体として見いだされ得る。上記化合物のそのような互変異性体も、本発明の一部である。さらに一般的に言えば、一般式 (I) [式中、X は、ヒドロキシ、スルファニル基又はアミノ基を表す。] で表される化合物の全ての互変異性体、及び、該調製方法において中間体として場合により使用可能で且つそれらの調製方法についての記載において定義されている化合物の互変異性体も、本発明の一部である。

10

【 0 0 1 2 】

本発明では、「A」基は、どの位置においても (X)_n で置換されることが可能であり、その際、X 及び n は、上記で定義されているとおりである。好ましくは、本発明は、一般式 (I) で表されるヘテロシクリルエチルベンズアミド誘導体に関し、ここで、種々の特性は、下記のものとして、単独で選択され得るか又は組み合わせて選択され得る：

- ・ n に関しては、n は、1 又は 2 である；
- ・ X に関しては、X は、メチル基、ハロゲン原子又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルであるように選択され、さらに好ましくは、X は、ハロゲン原子である。

20

【 0 0 1 3 】

本発明では、式 (I) の化合物のカルボキサミド部分の炭素原子は、R¹、R²、R³ 及び R⁴ で置換されており、ここで、R¹、R²、R³ 及び R⁴ は上記で定義されているとおりである。好ましくは、本発明は、一般式 (I) で表されるヘテロシクリルエチルベンズアミド誘導体にも関し、ここで、種々の特性は、下記のものとして、単独で選択され得るか又は組み合わせて選択され得る：

- ・ R¹ 及び R² に関しては、R¹ 及び R² は、互いに独立して、水素原子、C₁ - C₈ - アルキル、C₂ - C₈ - アルケニル、C₂ - C₈ - アルキニル、C₃ - C₈ - シクロアルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキル - C₁ - C₈ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₃ - C₈ - ハロゲノシクロアルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルであるように選択される；及び、
- ・ R³ 及び R⁴ に関しては、R³ 及び R⁴ は、互いに独立して、水素原子、C₁ - C₈ - アルキル、C₂ - C₈ - アルケニル、C₂ - C₈ - アルキニル、C₃ - C₈ - シクロアルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキル - C₁ - C₈ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₃ - C₈ - ハロゲノシクロアルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₈ - ハロゲノアルキルであるように選択される。

30

【 0 0 1 4 】

本発明では、式 (I) の化合物のカルボキサミド部分の窒素原子は、R⁵ で置換されており、ここで、R⁵ は、水素原子、C₁ - C₆ - アルキル又は C₃ - C₇ - シクロアルキルである。好ましくは、該 C₃ - C₇ - シクロアルキルは、シクロプロピルである。

40

【 0 0 1 5 】

本発明では、該フェニル部分は、オルト位が Y^a で置換されており、また、他の任意の位置は (Y)_p で置換され得、ここで、Y^a、Y 及び p は、上記で定義されているとおりである。好ましくは、本発明は、一般式 (I) で表されるヘテロシクリルエチルベンズアミド誘導体にも関し、ここで、種々の特性は、下記のものとして、単独で選択され得るか又は組み合わせて選択され得る：

- ・ Y^a に関しては、Y^a は、ハロゲン原子、ペンタフルオロ - ⁶ - スルファニル基、C₁ - C₈ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₈ - ハロゲノアルキ

50

ル又は1～5個のハロゲン原子を有するC₁-C₈-ハロゲノアルコキシであるように選択される；

- ・ pに関しては、pは1である；及び、
- ・ Yに関しては、Yは、水素原子又はハロゲン原子であるように選択され、さらに好ましくは、Yは水素原子である。

【0016】

本発明では、一般式(I)の化合物の「A」基は、同一であっても又は異なってもよい1個、2個又は3個のヘテロ原子を有する6員環式非縮合ヘテロ環である。好ましくは、本発明は、一般式(I)で表されるヘテロシクリルエチルベンズアミド誘導体にも関し、ここで、種々の特性は、下記のものとして、単独で選択され得るか又は組み合わせて

10

- ・ Aは、ピリダジン、ピリミジン又はピラジンであるように選択され、さらに好ましくは、Aはピリミジンである；及び、
- ・ Aは、オルト位が置換されている。

【0017】

「A」基の特定例としては、以下のものを挙げることができる。

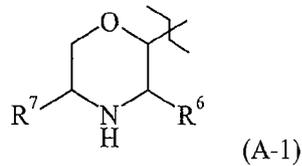
【0018】

- * Aは、一般式(A-1)

【0019】

【化7】

20



[式中、

- ・ R⁶は、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、C₁-C₄-アルキル、1～5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-アルキルチオ、1～5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルキルチオ又は1～5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルコキシであり得る

30

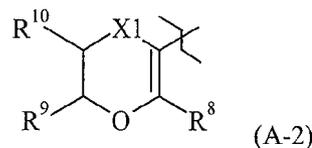
- ・ R⁷は、水素原子、C₁-C₄-アルキル、1～5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルキル又はベンジルであり得る。]
- のヘテロ環を表す。

【0020】

- * Aは、一般式(A-2)

【0021】

【化8】



40

[式中、

- ・ X¹は、硫黄原子、-SO-、-SO₂-又は-CH₂-であり得る；
- ・ R⁸は、C₁-C₄-アルキル又は1～5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルキルであり得る；及び
- ・ R⁹及びR¹⁰は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子又はC₁-C₄-アルキルであり得る。]

のヘテロ環を表す。

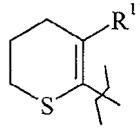
50

【 0 0 2 2 】

* A は、一般式 (A - 3)

【 0 0 2 3 】

【 化 9 】



(A-3)

10

[式中、

・ R¹¹ は、C₁ - C₄ - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₄ - ハロゲノアルキルであり得る。]

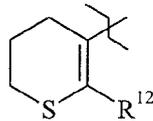
のヘテロ環を表す。

【 0 0 2 4 】

* A は、一般式 (A - 4)

【 0 0 2 5 】

【 化 1 0 】



(A-4)

20

[式中、

・ R¹² は、C₁ - C₄ - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₄ - ハロゲノアルキルであり得る。]

のヘテロ環を表す。

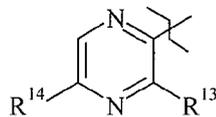
【 0 0 2 6 】

* A は、一般式 (A - 5)

【 0 0 2 7 】

【 化 1 1 】

30



(A-5)

[式中、

・ R¹³ は、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₄ - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₄ - ハロゲノアルキルであり得る；及び

・ R¹⁴ は、ハロゲン原子、C₁ - C₄ - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₄ - ハロゲノアルキルであり得る。]

のヘテロ環を表す。

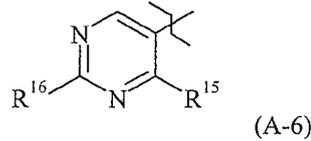
【 0 0 2 8 】

* A は、一般式 (A - 6)

【 0 0 2 9 】

40

【化12】



[式中、

・ R¹⁵ は、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₄ - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₄ - ハロゲノアルキルであり得る；及び

・ R¹⁶ は、ハロゲン原子、C₁ - C₄ - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₄ - ハロゲノアルキルであり得る。]

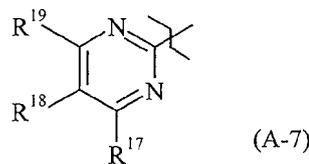
のヘテロ環を表す。

【0030】

* A は、一般式 (A - 7)

【0031】

【化13】



[式中、

・ R¹⁷ 及び R¹⁹ は、同一であっても又は異なってもよく、これらは、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₄ - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₄ - ハロゲノアルキルであり得る；及び

・ R¹⁸ は、ハロゲン原子、C₁ - C₄ - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₄ - ハロゲノアルキルであり得る。]

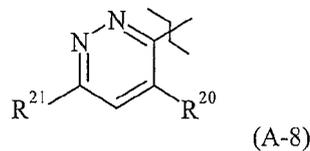
のヘテロ環を表す。

【0032】

* A は、一般式 (A - 8)

【0033】

【化14】



[式中、

・ R²⁰ は、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₄ - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₄ - ハロゲノアルキルであり得る；及び

・ R²¹ は、ハロゲン原子、C₁ - C₄ - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₄ - ハロゲノアルキルであり得る。]

のヘテロ環を表す。

【0034】

* A は、一般式 (A - 9)

【0035】

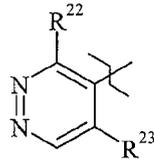
10

20

30

40

【化15】



(A-9)

[式中、

・ R^{22} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_4$ - アルキル又は1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキルであり得る；及び

・ R^{23} は、ハロゲン原子、 $C_1 - C_4$ - アルキル又は1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキルであり得る。]

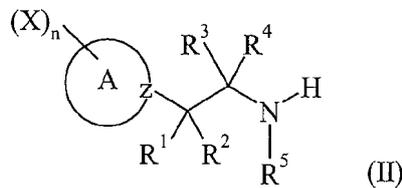
のヘテロ環を表す。

【0036】

本発明は、さらにまた、一般式(I)で表される化合物を調製する方法にも関する。かくして、本発明のさらに別の態様により、上記で定義されている一般式(I)で表される化合物を調製する方法が提供され、ここで、該方法は、一般式(II)

【0037】

【化16】



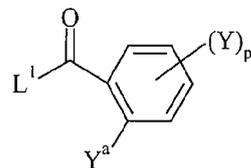
(II)

[式中、A、X、n、z、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 は、上記で定義されているとおりである。]

で表されるヘテロシクリルエチルアミン誘導体又はその塩のうちの1種類を、一般式(III)

【0038】

【化17】



(III)

[式中、

・ Y^a 、Y及びpは、上記で定義されているとおりであり；

・ L^1 は、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、 $-OR^{24}$ 又は $-OCOR^{24}$ であるように選択される脱離基であり、ここで、 R^{24} は、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、ベンジル、4 - メトキシベンジル、ペンタフルオロフェニル又は式

【0039】

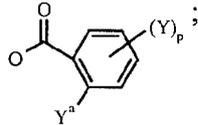
10

20

30

40

【化18】



で表される基である。]

で表されるカルボン酸誘導体と、触媒の存在下で、また、 L^1 がヒドロキシル基である場合は、縮合剤の存在下で、反応させることを含む。

【0040】

本発明の調製方法は、触媒の存在下で実施する。適切な触媒は、4 - ジメチル - アミノピリジン、1 - ヒドロキシ - ベンゾトリアゾール又はジメチルホルムアミドであるように選択することができる。

【0041】

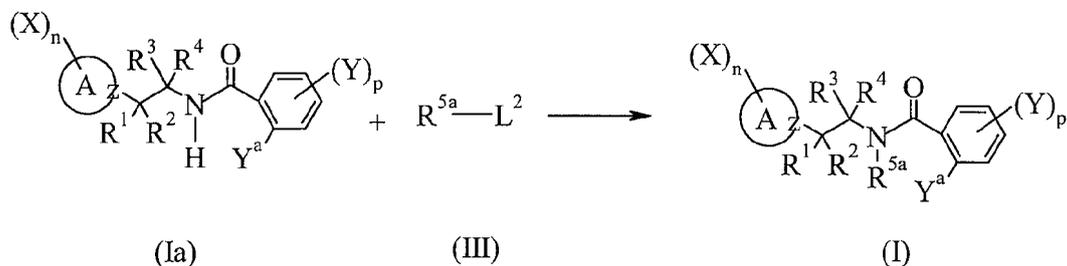
L^1 がヒドロキシ基である場合、本発明の調製方法は、縮合剤の存在下で実施する。適切な縮合剤は、酸ハロゲン化物形成物質 (former)、例えば、ホスゲン、三臭化リン、三塩化リン、五塩化リン、三塩化リン酸化物 (phosphorous trichloride oxide) 若しくは塩化チオニル；無水物形成物質、例えば、クロロギ酸エチル、クロロギ酸メチル、クロロギ酸イソプロピル、クロロギ酸イソブチル若しくはメタンスルホニルクロリド；カルボジイミド類、例えば、 N, N' - ジシクロヘキシルカルボジイミド (DCC)、又は、別の慣習的な縮合剤、例えば、五酸化リン、ポリリン酸、 N, N' - カルボニル - ジイミダゾール、2 - エトキシ - N - エトキシカルボニル - 1, 2 - ジヒドロキノリン (EEDQ)、トリフェニルホスフィン/テトラクロロメタン、4 - (4, 6 - ジメトキシ [1.3.5] トリアジン - 2 - イル) - 4 - メチルモルホリニウムクロリド水和物若しくはプロモ - トリピロリジノ - ホスホニウム - ヘキサフルオロホスフェートなどであるように選択することができる。

【0042】

R^5 が水素原子である場合、一般式 (I) で表される化合物を調製するための上記調製方法は、一般式 (Ia) で表される化合物を一般式 (III) で表される化合物と反応させて一般式 (I) で表される化合物を生成させることを含む以下の反応スキーム：

【0043】

【化19】



[ここで、

・ A 、 X 、 n 、 z 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 Y^a 、 Y 及び p は、上記で定義されているとおりであり；

・ R^{5a} は、 $C_1 - C_6$ - アルキル又は $C_3 - C_7$ - シクロアルキルであり；

・ L^2 は、ハロゲン原子、4 - メチルフェニルスルホニルオキシ又はメチルスルホニルオキシであるように選択される脱離基である。]

に従うさらなるステップで場合により完結させることができる。

【0044】

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 又は R^5 の定義に応じて、一般式 (II) で表されるアミン誘

10

20

30

40

50

導体は、種々の調製方法で調製することができる。そのような調製方法の1つの例(A)は、以下のとおりであり得る：

- ・ A、z、X及びnが、上記で定義されているとおりであり；
- ・ R¹及びR²が、独立して、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₇-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキルであるように選択され；
- ・ R³、R⁴及びR⁵が、水素原子である場合；

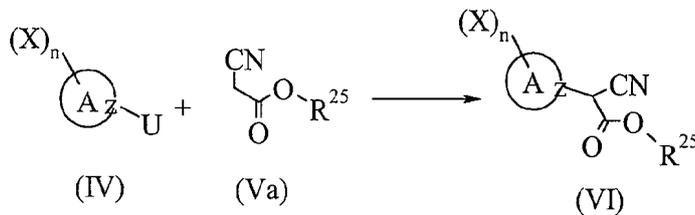
一般式(II)で表されるアミン誘導体は、以下のステップを含む調製方法に従って調製することができる：

- 反応スキーム(A-1)による第1ステップ：

スキーム(A-1)

【0045】

【化20】



10

[ここで、

- ・ A、z、X及びnは、上記で定義されているとおりであり；
- ・ R²⁵は、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、ベンジル、4-メトキシベンジル又はペンタフルオロフェニルであり；
- ・ Uは、ハロゲン、C₁-C₆-アルキルスルホネート又はC₁-C₆-ハロアルキルスルホネートであるように選択される脱離基である。]

20

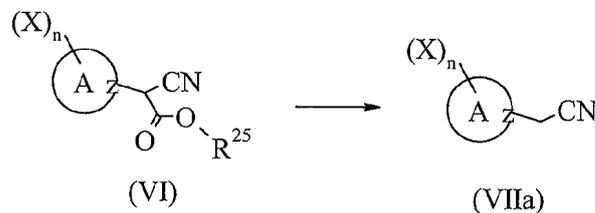
(ここで、該第1ステップは、一般式(Va)で表されるシアノアセテート誘導体を、塩基の存在下、0 ~ 200の温度で、一般式(IV)で表されるヘテロ環誘導体によりアリール化して、一般式(VI)で表されるヘテロシクリル-シアノアセテート誘導体を生成させることを含む。)

- 反応スキーム(A-2)による第2ステップ：

スキーム(A-2)

【0046】

【化21】



30

[ここで、

- ・ A、z、X及びnは、上記で定義されているとおりであり；
- ・ R²⁵は、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、ベンジル、4-メトキシベンジル又はペンタフルオロフェニルである。]

40

(ここで、該第2ステップは、一般式(VI)で表される化合物を、同一のポット内では異なるポット内で、塩基性加水分解又は酸性加水分解又はハロゲン化物による置換に付し、40から還流温度までの温度で加熱して、一般式(VIIa)で表されるヘテロシクリル-アセトニトリル誘導体を生成させることを含む。)

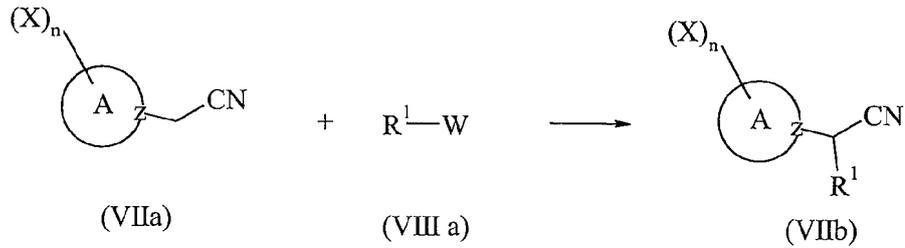
- 反応スキーム(A-3)による第3ステップ：

スキーム(A-3)

【0047】

50

【化22】



[ここで、

- ・ A、z、X及びnは、上記で定義されているとおりであり；
- ・ R¹は、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₇-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキルであり；
- ・ Wは、ハロゲン原子、C₁-C₆-アルキルスルホネート、C₁-C₆-ハロアルキルスルホネート又は4-メチル-フェニルスルホネートである。]

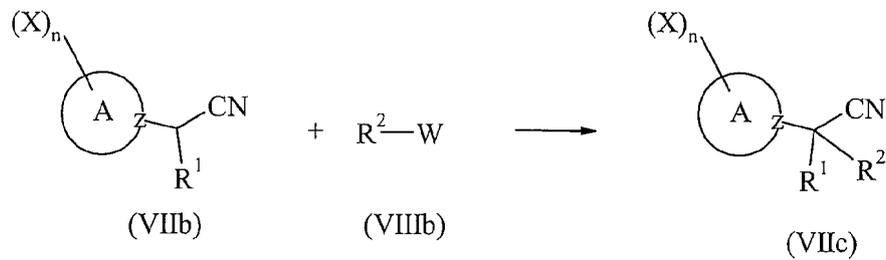
(ここで、該第3ステップは、一般式(VIIa)で表される化合物を一般式(VIIIa)で表される試薬でアルキル化して、一般式(VIIb)で表される化合物を生成させることを含む。)

- 反応スキーム(A-4)による第4ステップ：

スキーム(A-4)

【0048】

【化23】



[ここで、

- ・ A、z、X及びnは、上記で定義されているとおりであり；
- ・ R¹及びR²は、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₇-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキルであり；
- ・ Wは、ハロゲン原子、C₁-C₆-アルキルスルホネート、C₁-C₆-ハロアルキルスルホネート又は4-メチル-フェニルスルホネートである。]

(ここで、該第4ステップは、一般式(VIIb)で表される化合物を一般式(VIIIb)で表される試薬でアルキル化して、一般式(VIIc)で表される化合物を生成させることを含む。)

- 反応スキーム(A-5)による第5ステップ：

スキーム(A-5)

【0049】

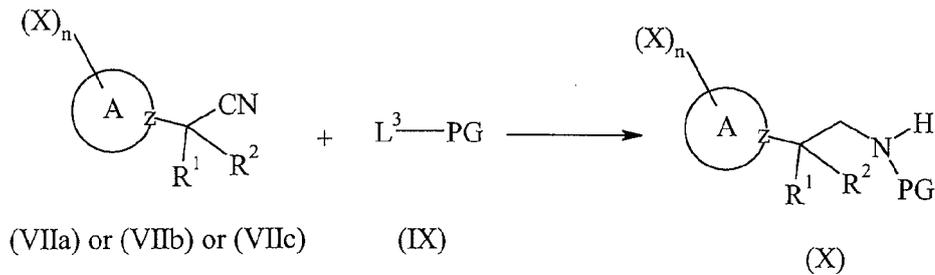
10

20

30

40

【化24】



[ここで、

- ・ A、z、X及びnは、上記で定義されているとおりであり；
- ・ R¹及びR²は、水素原子、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₇-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキルであり；
- ・ L³は、-OR²⁶基又は-OCOR²⁶基であるように選択される脱離基であり、ここで、R²⁶は、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、ベンジル、4-メトキシベンジル又はペンタフルオロフェニルであり；

・ PGは、保護基を表し、ここで、該保護基は、-COOR²⁷基又は-COR²⁷基（ここで、R²⁷は、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、ベンジル、4-メトキシベンジル又はペンタフルオロフェニルである）であり得る。]

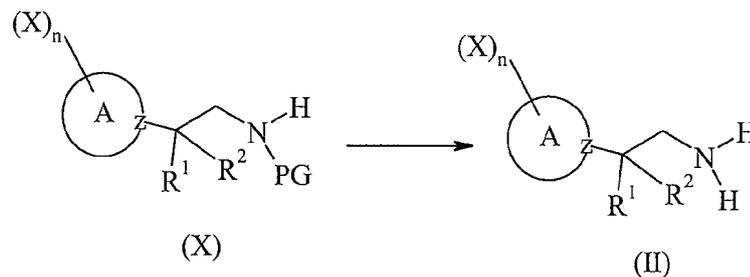
（ここで、該第5ステップは、触媒の存在下及び一般式（IX）で表される化合物の存在下、0～150の温度で、1パール～100パールの圧力下に、一般式（VIIa）、一般式（VIIb）又は一般式（VIIc）で表される化合物を水素化又は水素化物供与体により還元して、一般式（X）で表される化合物を生成させることを含む。）；

- 反応スキーム（A-6）による第6ステップ：

スキーム（A-6）

【0050】

【化25】



[ここで、

- ・ A、z、X及びnは、上記で定義されているとおりであり；
- ・ R¹及びR²は、水素原子、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₇-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキルであり；
- ・ PGは、保護基を表し、ここで、該保護基は、-COOR²⁸基又は-COR²⁸基（ここで、R²⁸は、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、ベンジル、4-メトキシベンジル又はペンタフルオロフェニルである）であり得る。]

（ここで、該第6ステップは、酸性媒体中又は塩基性媒体中で、一般式（X）で表される化合物を脱保護反応に付して、一般式（II）で表されるアミン誘導体又はその塩のうちの1種類を生成させることを含む。）。

【0051】

上記第1ステップ（ステップA-1）は、塩基の存在下で実施する。好ましくは、該塩基は、無機塩基又は有機塩基であるように選択される。そのような塩基の適切な例は、例えば、アルカリ土類金属又はアルカリ金属の水素化物、水酸化物、アミド、アルコラート、炭酸塩、炭酸水素塩若しくは酢酸塩、又は、第三級アミンなどであり得る。

10

20

30

40

50

【0052】

本発明の第1ステップ(ステップA-1)は、0 ~ 200 の温度で実施する。好ましくは、第1ステップ(ステップA-1)は、0 ~ 120 の温度、さらに好ましくは、0 ~ 80 の温度で実施する。

【0053】

本発明の第1ステップ(ステップA-1)は、溶媒の存在下で実施し得る。好ましくは、該溶媒は、水、有機溶媒、又は、水と有機溶媒の混合物であるように選択される。適切な有機溶媒は、例えば、脂肪族溶媒、脂環式溶媒又は芳香族溶媒であり得る。

【0054】

本発明の第1ステップ(ステップA-1)は、さらにまた、触媒の存在下でも実施し得る。好ましくは、該触媒は、パラジウム塩又はパラジウム錯体であるように選択される。さらに好ましくは、該触媒は、パラジウム錯体であるように選択される。適切なパラジウム錯体触媒は、例えば、反応混合物にパラジウム塩と錯体配位子を別々に添加することにより該反応混合物中で直接生成させ得る。適切な配位子は、例えば、バルキーなホスフィン配位子又はアルシン配位子、例えば、(R)-()-1-[(S)-2-(ジシクロヘキシルホスフィノ)フェロセニル]エチルジシクロヘキシルホスフィン及びその対応するエナンチオマー若しくはそれら両方の混合物；(R)-()-1-[(S)-2-(ジシクロヘキシルホスフィノ)フェロセニル]エチルジフェニルホスフィン及びその対応するエナンチオマー若しくはそれら両方の混合物；(R)-()-1-[(S)-2-(ジフェニルホスフィノ)フェロセニル]エチルジ-t-ブチルホスフィン及びその対応するエナンチオマー若しくはそれら両方の混合物；又は、(R)-()-1-[(S)-2-(ジフェニルホスフィノ)フェロセニル]エチルジシクロヘキシルホスフィン及びその対応するエナンチオマー若しくはそれら両方の混合物などであり得る。

【0055】

本発明の第5ステップ(ステップA-5)は、水素化物供与体の存在下で実施する。好ましくは、該水素化物供与体は、LiAlH₄、NaBH₄、KBH₄、B₂H₆などのような金属水素化物又は半金属水素化物であるように選択される。

【0056】

本発明の第5ステップ(ステップA-5)は、触媒の存在下で実施する。好ましくは、該触媒は、Co(II)塩化物、Ni(II)塩化物、アンモニア若しくはその塩のうちの1種類、炭素担持パラジウム、ラネーニッケル、ラネーコバルト又は白金であるように選択される。

【0057】

本発明の第5ステップ(ステップA-5)は、0 ~ 150 の温度で実施する。好ましくは、該温度は、10 ~ 120 である。さらに好ましくは、該温度は、10 ~ 80 である。

【0058】

本発明の第5ステップ(ステップA-5)は、1バール~100パールの圧力下で実施する。好ましくは、該圧力は、1バール~50バールである。

【0059】

本発明の第5ステップ(ステップA-5)は、有機溶媒の存在下、水の存在下、又は、それらの混合物の存在下で実施し得る。好ましくは、該溶媒は、エーテル、アルコール、カルボン酸、又は、それらと水の混合物、又は、純粋な水であるように選択される。

【0060】

本発明の化合物は、上記で記述した一般的な調製方法に準じて調製することができる。それにもかかわらず、当業者が、自分の一般的な知識及び利用可能な刊行物に基づいて、合成することが望まれる化合物のそれぞれの特性に応じて該方法を適合させることができるということは理解されるであろう。

【0061】

当業者は、自分の一般的な知識及び利用可能な刊行物に基づいて、本発明の一般式(V

10

20

30

40

50

)で表される中間体化合物を調製することもできる。

【0062】

本発明は、さらに、有効量の一般式(I)で表される活性物質を含んでいる殺菌剤組成物にも関する。かくして、本発明により、活性成分としての有効量の上記で定義されている一般式(I)の化合物、及び、農業上許容される支持体、担体又は増量剤を含んでいる殺菌剤組成物が提供される。

【0063】

本明細書において、用語「支持体(support)」は、該活性物質と組み合わせて、特に植物の一部に対して、より容易に施用できるようにする、天然又は合成の有機物質又は無機物質を意味する。このような支持体は、従って、一般に不活性であり、また、農業上許容されるものであるべきである。支持体は、固体であってもよいし、又は、液体であってもよい。適切な支持体の例としては、クレー、天然又は合成のシリケート、シリカ、樹脂、蠟、固形肥料、水、アルコール(特に、ブタノール)、有機溶媒、鉱油及び植物油、並びに、それらの誘導体などを挙げることができる。このような支持体の混合物を使用することもできる。

【0064】

上記組成物は、さらにまた、付加的な成分も含有することができる。特に、該組成物は、さらに、界面活性剤を含有することができる。該界面活性剤は、イオン性若しくは非イオン性のタイプの乳化剤、分散剤若しくは湿潤剤であることが可能であるか、又は、そのような界面活性剤の混合物であることが可能である。例えば、以下のものを挙げることができる：ポリアクリル酸塩、リグノスルホン酸塩、フェノールスルホン酸塩若しくはナフタレンスルホン酸塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールの重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪酸の重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪アミンの重縮合物、置換されているフェノール(特に、アルキルフェノール又はアリーールフェノール)、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導体(特に、アルキルタウレート)、ポリオキシエチル化アルコールのリン酸エステル若しくはポリオキシエチル化フェノールのリン酸エステル、ポリオールの脂肪酸エステル、並びに、硫酸官能基、スルホン酸官能基及びリン酸官能基を含んでいる上記化合物の誘導体。該活性物質及び/又は該不活性支持体が水不溶性である場合、及び、施用のための媒介物(vector agent)が水である場合、一般に、少なくとも1種類の界面活性剤を存在させることが必要である。好ましくは、界面活性剤の含有量は、該組成物の5重量%~40重量%であり得る。

【0065】

場合により、さらなる成分、例えば、保護コロイド、粘着剤、増粘剤、揺変剤、浸透剤、安定化剤、金属イオン封鎖剤などを含ませることもできる。さらに一般的には、該活性物質は、通常の製剤技術に従う固体又は液体の任意の添加剤と組み合わせることが可能である。

【0066】

一般に、本発明の組成物には、0.05~99%(重量基準)の活性物質、好ましくは、10~70重量%の活性物質を含有させることができる。

【0067】

本発明の組成物は、エアロゾルディスペンサー、カプセル懸濁液剤、冷煙霧濃厚剤(cold fogging concentrate)、散粉性粉剤、乳剤、水中油型エマルジョン剤、油中水型エマルジョン剤、カプセル化粒剤、細粒剤、種子処理用フロアブル剤、ガス剤(加圧下)、ガス生成剤(gas generating product)、粒剤、温煙霧濃厚剤(hot fogging concentrate)、大型粒剤、微粒剤、油分散性粉剤、油混和性フロアブル剤、油混和性液剤、ペースト剤、植物用棒状剤(plant rodlet)、乾燥種子処理用粉剤、農薬粉衣種子、可溶性濃厚剤(soluble concentrate)、可溶性粉剤、種子処理用溶液剤、懸濁液剤(フロアブル剤)、微量散布用液剤(ultra low volume (ulv) liquid)、微量散布用懸濁液剤(ultra low volume (ulv) suspension)、顆粒水和剤、水分散性錠剤、泥水処理用水和剤、水溶性顆粒剤、水溶性錠剤、種子処理用水溶性粉剤及び水和剤などのような、さまざまな形態で使

10

20

30

40

50

用することが可能である。

【 0 0 6 8 】

これらの組成物には、処理対象の植物又は種子に対して噴霧装置又は散粉装置のような適切な装置を用いて施用される状態にある組成物のみではなく、作物に対して施用する前に希釈することが必要な商業的な濃厚組成物も包含される。

【 0 0 6 9 】

本発明の化合物は、さらにまた、1種類以上の殺虫剤、殺菌剤、殺細菌剤、誘引性殺ダニ剤若しくはフェロモン、又は、生物学的活性を有する別の化合物と混合することもできる。そのようにして得られた混合物は、拡大された活性スペクトルを有する。別の殺菌剤との混合物が特に有利である。適切な混合相手殺菌剤の例は、以下のリストの中で選択し得る：

(1) 核酸合成を阻害し得る化合物、例えば、ベナラキシル、ベナラキシル - M、ピリメート、キララキシル (chiralaxyl)、クロジラコン、ジメチリモール、エチリモール、フララキシル、ヒメキサゾール、メフェノキサム、メタラキシル、メタラキシル - M、オフラセ、オキサジキシル、オキソリン酸；

(2) 有糸分裂及び細胞分裂を阻害し得る化合物、例えば、ベノミル、カルベンダジム、ジエトフェンカルブ、エタボキサム、フベリダゾール、ペンシクロン、チアベンダゾール、チオファネート - メチル、ゾキサミド；

(3) 呼吸を阻害し得る化合物、例えば、

C I - 呼吸阻害薬、例えば、ジフルメトリム；

C I I - 呼吸阻害薬、例えば、ボスカリド、カルボキシシン、フェンフラム、フルトラニル、フラメトピル、フルメシクロックス、メプロニル、オキシカルボキシシン、ペンチオピラド、チフルザミド；

C I I I - 呼吸阻害薬、例えば、アミスルブロム、アゾキシストロピン、シアゾファミド、ジモキシストロピン、エネストロビン (enestrobin)、ファモキサドン、フェンアミドン、フルオキサストロピン、クレソキシム - メチル、メトミノストロピン、オリサストロピン、ピコキシストロピン、ピラクロストロピン、トリフロキシストロピン；

(4) 脱共役剤として作用し得る化合物、例えば、ジノカップ、フルアジナム、メプチルジノカップ (meptyldinocap)；

(5) A T P 産生を阻害し得る化合物、例えば、酢酸トリフェニルスズ、塩化トリフェニルスズ、水酸化トリフェニルスズ、シルチオファム；

(6) A A 及びタンパク質の生合成を阻害し得る化合物、例えば、アンドプリム (andoprim)、プラストサイジン - S、シプロジニル、カスガマイシン、カスガマイシン塩酸塩水和物、メパニピリム、ピリメタニル；

(7) シグナル伝達を阻害し得る化合物、例えば、フェンピクロニル、フルジオキソニル、キノキシフェン；

(8) 脂質及び膜の合成を阻害し得る化合物、例えば、ピフェニル、クロゾリネート、エジフェンホス、ヨードカルブ (iodocarb)、イプロベンホス、イプロジオン、イソプロチオラン、プロシミドン、プロパモカルブ、プロパモカルブ塩酸塩、ピラゾホス、トルクロホス - メチル、ピンクロゾリン；

(9) エルゴステロールの生合成を阻害し得る化合物、例えば、アルジモルフ、アザコナゾール、ピテルタノール、プロムコナゾール、シプロコナゾール、ジクロブトラゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾール - M、ドデモルフ、酢酸ドデモルフ、エポキシコナゾール、エタコナゾール、フェナリモール、フェンブコナゾール、フェンヘキサミド、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、フルキンコナゾール、フルルプリミドール、フルシラゾール、フルトリアホール、フルコナゾール、フルコナゾール - シス、ヘキサコナゾール、イマザリル、硫酸イマザリル、イミベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、ミクロブタニル、ナフチフィン、ヌアリモール、オキシボコナゾール、パクロブトラゾール、ペフラゾエート、ペンコナゾール、プロクロラズ、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、ピリプチカルブ、ピリフェノックス、シメコナゾー

10

20

30

40

50

ル、スピロキサミン、テブコナゾール、テルピナフィン、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリデモルフ、トリフルミゾール、トリホリン、トリチコナゾール、ウニコナゾール、ピニコナゾール、ポリコナゾール；

(10) 細胞壁の合成を阻害し得る化合物、例えば、ベンチアバリカルブ、ピアラホス、ジメトモルフ、フルモルフ (flumorph)、イプロバリカルブ、ポリオキシシ、ポリオキソリム、バリダマイシン A；

(11) メラニンの生合成を阻害し得る化合物、例えば、カルプロパミド、ジクロシメット、フェノキサニル、フタリド、ピロキロン、トリシクラゾール；

(12) 宿主の防御を誘発し得る化合物、例えば、アシベンゾラル - S - メチル、プロベナゾール、チアジニル；

(13) 多部位に作用し得る化合物、例えば、ボルドー液、キャプタホール、キャプタン、クロロタロニル、ナフテン酸銅、酸化銅、塩基性塩化銅、銅剤、例えば、水酸化銅、硫酸銅、ジクロフルアニド、ジチアノン、ドジン、ドジン遊離塩基、ファーバム、フルオロホルベット、ホルベット、グアザチン、酢酸グアザチン、イミノクタジン、イミノクタジンアルベシル酸塩、イミノクタジン三酢酸塩、マンカップパー、マンゼブ、マンネブ、メチラム、メチラム亜鉛 (metiram zinc)、オキシシ銅、プロピネブ、硫黄及び硫黄剤、例えば、多硫化カルシウム、チウラム、トリルフルアニド、ジネブ、ジラム；

(14) 以下のリストの中で選択される化合物：(2E) - 2 - (2 - { [6 - (3 - クロロ - 2 - メチルフェノキシ) - 5 - フルオロピリミジン - 4 - イル] オキシ} フェニル) - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチルアセトアミド、(2E) - 2 - { 2 - [({ [(1E) - 1 - (3 - { [(E) - 1 - フルオロ - 2 - フェニルビニル] オキシ} フェニル) エチリデン] アミノ } オキシ) メチル] フェニル } - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチルアセトアミド、1 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) シクロヘプタノール、1 - [(4 - メトキシフェノキシ) メチル] - 2, 2 - ジメチルプロピル 1H - イミダゾール - 1 - カルボキシレート、2 - (4 - クロロフェニル) - N - { 2 - [3 - メトキシ - 4 - (プロブ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] エチル } - 2 - (プロブ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) アセトアミド、2, 3, 5, 6 - テトラクロロ - 4 - (メチルスルホニル) ピリジン、2 - ブトキシ - 6 - ヨード - 3 - プロピル - 4H - クロメン - 4 - オン、2 - クロロ - N - (1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル) ニコチンアミド、2 - フェニルフェノール及び塩、3, 4, 5 - トリクロロピリジン - 2, 6 - ジカルボニトリル、3, 4 - ジクロロ - N - (2 - シアノフェニル) イソチアゾール - 5 - カルボキサミド、3 - [5 - (4 - クロロフェニル) - 2, 3 - ジメチルイソオキサゾリジン - 3 - イル] ピリジン、5 - クロロ - 6 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - N - [(1R) - 1, 2, 2 - トリメチルプロピル] [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 7 - アミン、5 - クロロ - 7 - (4 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 6 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリミジン、5 - クロロ - N - [(1R) - 1, 2 - ジメチルプロピル] - 6 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 7 - アミン、8 - ヒドロキシキノリンスルフェート、ベンチアゾール、ベトキサジン、カプシマイシン (capsimycin)、カルボン、キノメチオネート、クフラネブ、シフルフェナミド、シモキサニル、ダゾメット、デバカルブ (debacarb)、ジクロロフェン、ジクロメジン、ジクロラン、ジフェンゾコート、ジフェンゾコートメチル硫酸塩、ジフェニルアミン、フェリムゾン、フルメトベル、フルオピコリド、フルオルイミド、フルスルファミド、ホセチル - アルミニウム、ホセチル - カルシウム、ホセチル - ナトリウム、ヘキサクロロベンゼン、イルママイシン、メタスルホカルブ、(2 - クロロ - 5 - { (1E) - N - [(6 - メチルピリジン - 2 - イル) メトキシ] エタンイミドイル } ベンジル) カルバミン酸メチル、(2E) - 2 - { 2 - [({ シクロプロピル [(4 - メトキシフェニル) イミノ] メチル } チオ) メチル] フェニル } - 3 - メトシアクリル酸メチル、1 - (2, 2 - ジメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル) - 1H - イミダゾール - 5 - カルボン酸メチル

10

20

30

40

50

、 3 - (4 - クロロフェニル) - 3 - { [N - (イソプロポキシカルボニル) バリル] アミノ } プロパン酸メチル、イソチオシアン酸メチル、メトラフェノン、ミルディオマイシン、N - (3 ' , 4 ' - ジクロロ - 5 - フルオロピフェニル - 2 - イル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、N - (3 - エチル - 3 , 5 , 5 - トリメチルシクロヘキシル) - 3 - (ホルミルアミノ) - 2 - ヒドロキシベンズアミド、N - (4 - クロロ - 2 - ニトロフェニル) - N - エチル - 4 - メチルベンゼンスルホンアミド、N - [(5 - ブロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) メチル] - 2 , 4 - ジクロロニコチンアミド、N - [1 - (5 - ブロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) エチル] - 2 , 4 - ジクロロニコチンアミド、N - [1 - (5 - ブロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) エチル] - 2 - フルオロ - 4 - ヨードニコチンアミド、N - [2 - (4 - { [3 - (4 - クロロフェニル) プロブ - 2 - イン - 1 - イル] オキシ } - 3 - メトキシフェニル) エチル] - N ² - (メチルスルホニル) バリンアミド、N - { (Z) - [(シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 , 3 - ジフルオロフェニル] メチル } - 2 - フェニルアセトアミド、N - { 2 - [3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル] エチル } - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド、ナタマイシン、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、ニトロタル - イソプロピル、O - { 1 - [(4 - メトキシフェノキシ) メチル] - 2 , 2 - ジメチルプリピル } 1 H - イミダゾール - 1 - カルボチオエート、オクチリノン、オキサモカルブ (oxamocarb)、オキシフェンチイン (oxyfenthin)、ペンタクロロフェノール及び塩、亜リン酸及びその塩、ピペラリン、プロパモカルブホセチレート (prop amocarb fosetylalte)、プロパノシン - ナトリウム (propanosine-sodium)、プロキナジド、ピロールニトリン、キントゼン、テクロフタラム、テクナゼン、トリアゾキシド、トリクラミド、並びに、ザリラミド。

10

20

【 0 0 7 0 】

式 (I) で表される化合物と殺細菌活性化合物の混合物を含んでいる本発明の組成物も、特に有利であり得る。適切な混合相手殺細菌剤の例は、以下のリストの中で選択し得る：プロノポール、ジクロロフェン、ニトラピリン、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、カスガマイシン、オクチリノン、フランカルボン酸、オキシテトラサイクリン、プロベナゾール、ストレプトマイシン、テクロフタラム、硫酸銅及び他の銅剤。

【 0 0 7 1 】

本発明の殺菌剤組成物を使用して、作物の植物病原性菌類を治療的又は予防的に防除することができる。かくして、本発明のさらに別の態様により、作物の植物病原性菌類を治療的又は予防的に防除する方法が提供され、ここで、該方法は、上記で定義した殺菌剤組成物を、種子、植物及び/若しくは植物の果実に施用するか、又は、植物が生育している土壤若しくは植物を栽培するのが望ましい土壤に施用することを特徴とする。

30

【 0 0 7 2 】

作物の植物病原性菌類に対して使用する該組成物は、有効で且つ植物に対して毒性を示さない量の一般式 (I) で表される活性物質を含有している。

【 0 0 7 3 】

「有効で且つ植物に対して毒性を示さない量」という表現は、作物上に存在しているか又はおそらく出現するであろう菌類を防除又は駆除するのに充分で、且つ、該作物について植物毒性の感知可能などのような症状も引き起こすことのない、本発明組成物の量を意味する。そのような量は、防除対象の菌類、作物の種類、気候条件、及び、本発明の殺菌剤組成物に含まれている化合物に応じて、広い範囲で変動し得る。

40

【 0 0 7 4 】

そのような量は、当業者が実行可能な範囲内にある体系的な圃場試験により決定することが可能である。

【 0 0 7 5 】

本発明による処置方法は、塊茎又は根茎のような繁殖材料を処置するのに有効であるのみではなく、種子、実生又は移植実生 (seedlings pricking out) 及び植物又は移植植物

50

(plants pricking out) を処置するのにも有効である。この処置方法は、根を処置するのにも有効であり得る。本発明による処置方法は、関係している植物の樹幹、茎又は柄、葉、花及び果実のような植物の地上部を処置するのにも有効であり得る。

【 0 0 7 6 】

本発明の方法で保護可能な植物の中で、以下のものを挙げるができる：ワタ；アマ；ブドウ；果実又は野菜、例えば、バラ科各種 (Rosaceae sp.) (例えば、ピップフルーツ (pip fruit)、例えば、リンゴ及びナシ、さらに、核果、例えば、アンズ、アーモンド及びモモ)、リベシオイダ工科各種 (Ribesioideae sp.)、クルミ科各種 (Juglandaceae sp.)、カバノキ科各種 (Betulaceae sp.)、ウルシ科各種 (Anacardiaceae sp.)、ブナ科各種 (Fagaceae sp.)、クワ科各種 (Moraceae sp.)、モクセイ科各種 (Oleaceae sp.)、マタタビ科各種 (Actinidaceae sp.)、クスノキ科各種 (Lauraceae sp.)、パシヨウ科各種 (Musaceae sp.) (例えば、バナナの木及びプランタン)、アカネ科各種 (Rubiaceae sp.)、ツバキ科各種 (Theaceae sp.)、アオギリ科各種 (Sterculiaceae sp.)、ミカン科各種 (Rutaceae sp.) (例えば、レモン、オレンジ及びグレープフルーツ)；ナス科各種 (Solanaceae sp.) (例えば、トマト)、ユリ科各種 (Liliaceae sp.)、キク科各種 (Asteraceae sp.) (例えば、レタス)、セリ科各種 (Umbelliferae sp.)、アブラナ科各種 (Cruciferae sp.)、アカザ科各種 (Chenopodiaceae sp.)、ウリ科各種 (Cucurbitaceae sp.)、マメ科各種 (Papilionaceae sp.) (例えば、エンドウ)、バラ科各種 (Rosaceae sp.) (例えば、イチゴ)；主要作物 (major crop)、例えば、イネ科各種 (Graminae sp.) (例えば、トウモロコシ、芝、又は、禾穀類、例えば、コムギ、イネ、オオムギ及びライコムギ)、キク科各種 (Asteraceae sp.) (例えば、ヒマワリ)、アブラナ科各種 (Cruciferae sp.) (例えば、ナタネ)、マメ科各種 (Fabaceae sp.) (例えば、ピーナッツ)、マメ科各種 (Papilionaceae sp.) (例えば、ダイズ)、ナス科各種 (Solanaceae sp.) (例えば、ジャガイモ)、アカザ科各種 (Chenopodiaceae sp.) (例えば、ビートルート (beetroot))；園芸作物及び森林作物 (forest crops)；さらに、これら作物の遺伝子組み換えが行われた相同物。

【 0 0 7 7 】

本発明の方法で防除可能な植物又は作物の病害の中で、以下のものを挙げるができる：

- ・ うどんこ病 (powdery mildew disease)、例えば、ブルメリア (Blumeria) 病、例えば、ブルメリア・グラミニス (Blumeria graminis) に起因するもの；
- ポドスファエラ (Podosphaera) 病、例えば、ポドスファエラ・レウコトリカ (Podosphaera leucotricha) に起因するもの；
- スファエロテカ (Sphaerotheca) 病、例えば、スファエロテカ・フリギネア (Sphaerotheca fuliginea) に起因するもの；
- ウンシヌラ (Uncinula) 病、例えば、ウンシヌラ・ネカトル (Uncinula necator) に起因するもの；
- ・ さび病 (rust disease)、例えば、ギムノスポランギウム (Gymnosporangium) 病、例えば、ギムノスポランギウム・サビナエ (Gymnosporangium sabinae) に起因するもの；
- ヘミレイア (Hemileia) 病、例えば、ヘミレイア・バスタトリクス (Hemileia vastatrix) に起因するもの；
- ファコプソラ (Phakopsora) 病、例えば、ファコプソラ・パキリジ (Phakopsora pachyrhizi) 又はファコプソラ・メイボミアエ (Phakopsora meibomiae) に起因するもの；
- プッシニア (Puccinia) 病、例えば、プッシニア・レコンジタ (Puccinia recondita) に起因するもの；
- ウロミセス (Uromyces) 病、例えば、ウロミセス・アペンジクラツス (Uromyces appendiculatus) に起因するもの；
- ・ 卵菌類による病害 (Oomycete disease)、例えば、

10

20

30

40

50

ブレミア (*Bremia*) 病、例えば、ブレミア・ラクツカエ (*Bremia lactucae*) に起因するもの；

ペロノスポラ (*Peronospora*) 病、例えば、ペロノスポラ・ピシ (*Peronospora pisi*) 又はペロノスポラ・ブラシカエ (*P. brassicae*) に起因するもの；

フィトフトラ (*Phytophthora*) 病、例えば、フィトフトラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*) に起因するもの；

プラスモパラ (*Plasmopara*) 病、例えば、プラスモパラ・ビチコラ (*Plasmopara viticola*) に起因するもの；

プセウドペロノスポラ (*Pseudoperonospora*) 病、例えば、プセウドペロノスポラ・フムリ (*Pseudoperonospora humuli*) 又はプセウドペロノスポラ・クベンシス (*Pseudoperonospora cubensis*) に起因するもの；

ピシウム (*Pythium*) 病、例えば、ピシウム・ウルチムム (*Pythium ultimum*) に起因するもの；

・ 葉斑点性、葉汚斑性及び葉枯れ性の病害 (leafspot, leaf blotch and leaf blight disease)、例えば、

アルテルナリア (*Alternaria*) 病、例えば、アルテルナリア・ソラニ (*Alternaria solani*) に起因するもの；

セルコスポラ (*Cercospora*) 病、例えば、セルコスポラ・ベチコラ (*Cercospora beticola*) に起因するもの；

クラジオスポルム (*Cladosporium*) 病、例えば、クラジオスポルム・ククメリヌム (*Cladosporium cucumerinum*) に起因するもの；

コクリオボルス (*Cochliobolus*) 病、例えば、コクリオボルス・サチブス (*Cochliobolus sativus*) に起因するもの；

コレトトリクム (*Colletotrichum*) 病、例えば、コレトトリクム・リンデムタニウム (*Colletotrichum lindemuthianum*) に起因するもの；

シクロコニウム (*Cycloconium*) 病、例えば、シクロコニウム・オレアギヌム (*Cycloconium oleaginum*) に起因するもの；

ジアポルテ (*Diaporthe*) 病、例えば、ジアポルテ・シトリ (*Diaporthe citri*) に起因するもの；

エルシノエ (*Elsinoe*) 病、例えば、エルシノエ・ファウセッチイ (*Elsinoe fawcettii*) に起因するもの；

グロエオスポリウム (*Gloeosporium*) 病、例えば、グロエオスポリウム・ラエチコロール (*Gloeosporium laeticolor*) に起因するもの；

グロメラ (*Glomerella*) 病、例えば、グロメラ・シングラタ (*Glomerella cingulata*) に起因するもの；

グイグナルジア (*Guignardia*) 病、例えば、グイグナルジア・ビドウェリ (*Guignardia bidwellii*) に起因するもの；

レプトスファエリア (*Leptosphaeria*) 病、例えば、レプトスファエリア・マ克蘭ス (*Leptosphaeria maculans*) 又はレプトスファエリア・ノドルム (*Leptosphaeria nodorum*) に起因するもの；

マグナポルテ (*Magnaporthe*) 病、例えば、マグナポルテ・グリセア (*Magnaporthe grisea*) に起因するもの；

ミコスファエレラ (*Mycosphaerella*) 病、例えば、ミコスファエレラ・グラミニコラ (*Mycosphaerella graminicola*)、ミコスファエレラ・アラキジコラ (*Mycosphaerella arachidicola*) 又はミコスファエレラ・フィジエンシス (*Mycosphaerella fijiensis*) に起因するもの；

ファエオスファエリア (*Phaeosphaeria*) 病、例えば、ファエオスファエリア・ノドルム (*Phaeosphaeria nodorum*) に起因するもの；

ピレノホラ (*Pyrenophora*) 病、例えば、ピレノホラ・テレス (*Pyrenophora teres*) に起因するもの；

10

20

30

40

50

ルムラリア (*Ramularia*) 病、例えば、ルムラリア・コロ - シグニ (*Ramularia collo-cygni*) に起因するもの；

リンコスפורウム (*Rhynchosporium*) 病、例えば、リンコスפורウム・セカリス (*Rhynchosporium secalis*) に起因するもの；

セプトリア (*Septoria*) 病、例えば、セプトリア・アピイ (*Septoria apii*) 又はセプトリア・リコペルシシ (*Septoria lycopersici*) に起因するもの；

チフラ (*Typhula*) 病、例えば、チフラ・インカルナタ (*Typhula incarnata*) に起因するもの；

ベンツリア (*Venturia*) 病、例えば、ベンツリア・イナエクアリス (*Venturia inaequalis*) に起因するもの；

・ 根及び茎の病害 (root and stem disease)、例えば、

コルチシウム (*Corticium*) 病、例えば、コルチシウム・グラミネアルム (*Corticium graminearum*) に起因するもの；

フサリウム (*Fusarium*) 病、例えば、フサリウム・オキシスポルム (*Fusarium oxysporum*) に起因するもの；

ガエウマンノミセス (*Gaeumannomyces*) 病、例えば、ガエウマンノミセス・グラミニス (*Gaeumannomyces graminis*) に起因するもの；

リゾクトニア (*Rhizoctonia*) 病、例えば、リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) に起因するもの；

タペシア (*Tapesia*) 病、例えば、タペシア・アクホルミス (*Tapesia acuformis*) に起因するもの；

チエラビオプシス (*Thielaviopsis*) 病、例えば、チエラビオプシス・バシコラ (*Thielaviopsis basicola*) に起因するもの；

・ 穂の病害 (ear and panicle disease)、例えば、

アルテルナリア (*Alternaria*) 病、例えば、アルテルナリア属種 (*Alternaria* spp.) に起因するもの；

アスペルギルス (*Aspergillus*) 病、例えば、アスペルギルス・フラブス (*Aspergillus flavus*) に起因するもの；

クラドスポリウム (*Cladosporium*) 病、例えば、クラドスポリウム属種 (*Cladosporium* spp.) に起因するもの；

クラビセプス (*Claviceps*) 病、例えば、クラビセプス・プルブレア (*Claviceps purpurea*) に起因するもの；

フサリウム (*Fusarium*) 病、例えば、フサリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*) に起因するもの；

ジベレラ (*Gibberella*) 病、例えば、ジベレラ・ゼアエ (*Gibberella zeae*) に起因するもの；

モノグラフェラ (*Monographella*) 病、例えば、モノグラフェラ・ニバリス (*Monographella nivalis*) に起因するもの；

・ 黒穂病 (smut and bunt disease)、例えば、

スファセロテカ (*Sphacelotheca*) 病、例えば、スファセロテカ・レイリアナ (*Sphacelotheca reiliana*) に起因するもの；

チレチア (*Tilletia*) 病、例えば、チレチア・カリエス (*Tilletia caries*) に起因するもの；

ウロシスチス (*Urocystis*) 病、例えば、ウロシスチス・オクルタ (*Urocystis occulta*) に起因するもの；

ウスチラゴ (*Ustilago*) 病、例えば、ウスチラゴ・ヌダ (*Ustilago nuda*) に起因するもの；

・ 果実の腐敗性及び黴性の病害 (fruit rot and mould disease)、例えば、

アスペルギルス (*Aspergillus*) 病、例えば、アスペルギルス・フラブス (*Aspergillus flavus*) に起因するもの；

10

20

30

40

50

ボトリチス (*Botrytis*) 病、例えば、ボトリチス・シネレア (*Botrytis cinerea*) に起因するもの；

ペニシリウム (*Penicillium*) 病、例えば、ペニシリウム・エクспанスム (*Penicillium expansum*) に起因するもの；

スクレロチニア (*Sclerotinia*) 病、例えば、スクレロチニア・スクレロチオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*) に起因するもの；

ベルチシリウム (*Verticillium*) 病、例えば、ベルチシリウム・アルボアトルム (*Verticillium alboatrum*) に起因するもの；

・ 種子及び土壌が媒介する腐朽性、黴性、萎凋性、腐敗性及び苗立ち枯れ性の病害 (seed and soilborne decay, mould, wilt, rot and damping-off disease)、

フサリウム (*Fusarium*) 病、例えば、フサリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*) に起因するもの；

フィトフトラ (*Phytophthora*) 病、例えば、フィトフトラ・カクトルム (*Phytophthora cactorum*) に起因するもの；

ピシウム (*Pythium*) 病、例えば、ピシウム・ウルチムム (*Pythium ultimum*) に起因するもの；

リゾクトニア (*Rhizoctonia*) 病、例えば、リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) に起因するもの；

スクレロチウム (*Sclerotium*) 病、例えば、スクレロチウム・ロルフシイ (*Sclerotium rolfsii*) に起因するもの；

ミクロドキウム (*Microdochium*) 病、例えば、ミクロドキウム・ニバレ (*Microdochium nivale*) に起因するもの；

・ 腐乱性病害、開花病及び枯れ込み性病害 (canker, broom and dieback disease)、例えば、

ネクトリア (*Nectria*) 病、例えば、ネクトリア・ガリゲナ (*Nectria galligena*) に起因するもの；

・ 枯損性病害 (blight disease)、例えば、

モニリニア (*Monilinia*) 病、例えば、モニリニア・ラキサ (*Monilinia laxa*) に起因するもの；

・ 葉水泡性病害又は縮葉病 (leaf blister or leaf curl disease)、例えば、

タフリナ (*Taphrina*) 病、例えば、タフリナ・デホルマンズ (*Taphrina deformans*) に起因するもの；

・ 木本植物の衰退性病害 (decline disease of wooden plant)、例えば、

エスカ (*Esca*) 病、例えば、ファエモニエラ・クラミドスポラ (*Phaemoniella clamydospora*) に起因するもの；

・ 花及び種子の病害、例えば、

ボトリチス (*Botrytis*) 病、例えば、ボトリチス・シネレア (*Botrytis cinerea*) に起因するもの；

・ 塊茎の病害、例えば、

リゾクトニア (*Rhizoctonia*) 病、例えば、リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) に起因するもの。

【 0 0 7 8 】

本発明の殺菌剤組成物は、材木の表面又は内部で発生するであろう菌類病に対しても使用することができる。用語「材木 (timber)」は、全ての種類の木、そのような木を建築用に加工した全てのタイプのもの、例えば、ソリッドウッド、高密度木材、積層木材及び合板などを意味する。本発明による材木の処理方法は、主に、本発明の1種類以上の化合物又は本発明の組成物を接触させることにより行う。これには、例えば、直接的な塗布、噴霧、浸漬、注入、又は、別の適切な任意の方法が包含される。

【 0 0 7 9 】

本発明の処理において通常施用される活性物質の薬量は、茎葉処理における施用では、

10

20

30

40

50

一般に、また、有利には、10～800g/ha、好ましくは、50～300g/haである。種子処理の場合は、活性物質の施用薬量は、一般に、また、有利には、種子100kg当たり2～200g、好ましくは、種子100kg当たり3～150gである。上記で示されている薬量が本発明を例証するための例として挙げられているということは、明確に理解される。当業者は、処理対象の作物の種類に応じて、該施用薬量を適合させる方法を理解するであろう。

【0080】

本発明の殺菌剤組成物は、さらにまた、遺伝子組み換え生物の本発明化合物又は本発明農薬組成物による処理においても使用することができる。遺伝子組み換え植物は、興味深いタンパク質をコードする異種の遺伝子がゲノムに安定的に組み込まれている植物である。「興味深いタンパク質をコードする異種の遺伝子(heterologous gene encoding a protein of interest)」という表現は、本質的に、形質転換された植物に新しい農業的特性を付与する遺伝子を意味するか、又は、形質転換された植物の農業的特性を改善するための遺伝子を意味する。

10

【0081】

本発明の組成物は、さらにまた、例えば、真菌症、皮膚病、白癬菌性疾患(trichophyton disease)及びカンジダ症、又は、アスペルギルス属種(*Aspergillus* spp.) (例えば、アスペルギルス・フミガツス(*Aspergillus fumigatus*))に起因する疾患のようなヒト及び動物の菌類病を治療的又は予防的に処置するのに有用な組成物を調製するのに使用することもできる。

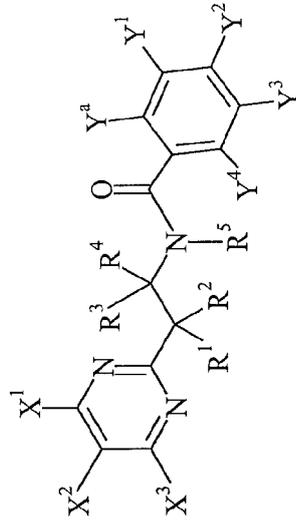
20

【0082】

本発明の態様について、化合物についての下記表及び下記実施例を参照して説明する。以下の表は、本発明の殺菌性化合物の例について非限定的に例証している。下記実施例において、「M+1」(又は、「M-1」)は、それぞれ、質量分析において観察された分子イオンピークプラス1a.m.u.(原子質量単位)又はマイナス1a.m.u.(原子質量単位)を意味し、M(Ap c I+)は、質量分析におけるポジティブ大気圧化学イオン化法で見いだされた分子イオンピークを意味する。

【0083】

【表 1】



化合物	X ¹	X ²	X ³	Y ^a	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	M+1
A-1	H	Br	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	H	374

10

20

30

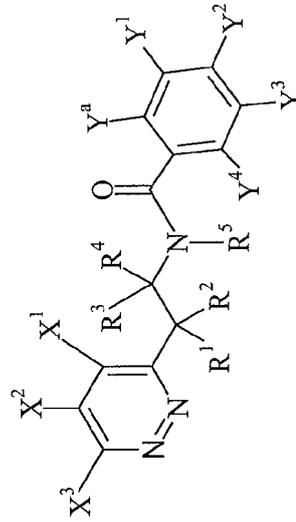
表A

【 0 0 8 4 】

【表 2】

表 B

【 0 0 8 5 】



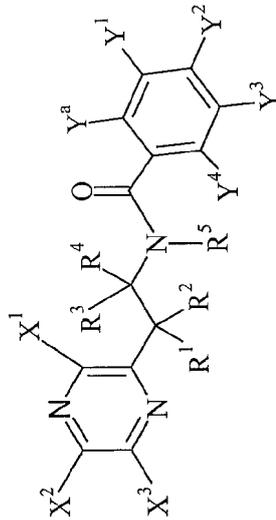
化合物	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	M+1
B-1	H	H	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	H	330

10

20

30

【表 3】



化合物	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	M+1
C-1	H	H	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	H	330

表C

【実施例】

【0086】

一般式(I)で表される化合物の調製方法についての実施例

N-[2-(5-ブロモピリミジン-2-イル)エチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(化合物(A-1))の合成 40

(5-ブロモピリミジン-2-イル)(シアノ)酢酸エチルの合成

テトラヒドロフラン(20 mL)中の水素化ナトリウム(油中60%, 34.55 mmol)の冷却した懸濁液を撹拌しながら、それに、1.17 gのシアノ酢酸エチル(10.34 mmol)を10分間かけて少量ずつ添加した。泡立ちが止んだ後、その濁った黄色の混合物を撹拌しながら室温まで昇温させた。30 mLのテトラヒドロフラン中の2.00 gの5-ブロモ、2-プロモ-ピリミジン(10.34 mmol)を添加した。その混合物を室温で6時間撹拌した。生じた褐色の混合物を減圧下に濃縮することにより、鮮褐色の沈澱物が得られた。その沈澱物に水(200 mL)を添加した。ヘプタン(200 mL)で抽出した後、水相を、HCl(1 M)を添加することによって酸性化した。生じ 50

た沈澱物を濾過により集め、乾燥させて、(5-プロモピリミジン-2-イル)(シアノ)酢酸エチルを鮮褐色の粉状物として得た(0.67g, 収率=24%)。

¹H NMR (ppm, DMSO-d₆): 3.5 (b, 1H); 8.9 (b, 1H); 8.45 (b, 1H); 4.24 (t, 2H); 1.25 (t, 3H)。

【0087】

(5-プロモピリミジン-2-イル)アセトニトリルの合成

ジメチルスルホキシド(20mL)中の2.70gの(5-プロモピリミジン-2-イル)(シアノ)酢酸エチル(9.970mmol)に、0.584gの塩化ナトリウム(9.970mmol)及び0.18mLの水(9.970mmol)を添加した。その混合物を、窒素雰囲気下、120 で3時間加熱した。その混合物を水(300mL)に注ぎ入れた。生じた沈澱物を濾過により集めて、(5-プロモピリミジン-2-イル)アセトニトリルを得た(0.6g, 収率=30%)。

10

【0088】

その透明な黄色の濾液を、塩化ナトリウムの飽和溶液を添加することにより塩で処理し、水酸化ナトリウムで中和して、赤色の溶液を得た。それを、次いで、ジクロロメタンで抽出した。有機相を集め、硫酸マグネシウムで脱水し、減圧下に蒸発させて、暗色の油状物を得た。それを、溶離液としてヘプタン/酢酸エチル(2/1)を用いるフラッシュクロマトグラフィーで精製して、(5-プロモピリミジン-2-イル)アセトニトリルを得た(0.9g, 収率=43%)。

¹H NMR (ppm, CDCl₃): 9.0 (s, 2H); 4.25 (s, 2H)

20

【0089】

[2-(5-プロモピリミジン-2-イル)エチル]カルバミン酸t-ブチルの合成

(5-プロモピリミジン-2-イル)アセトニトリル(0.9g)とt-ブチルオキシカルボネート(1.98g; 2当量)と塩化ニッケル6水和物(1.08g)の冷却した(-5 ~ 0)混合物を窒素雰囲気下で攪拌しながら、それに、水素化ホウ素ナトリウム(0.86g; 5当量)を少量ずつ添加した。添加完了後、その混合物を6時間攪拌しながら室温まで昇温させ、一晩放置した。

【0090】

その混合物を酢酸エチル(200mL)で希釈し、ケイ藻土を通して濾過した。濾液をブラインで洗浄した。有機相を集め、MgSO₄で脱水し、減圧下に蒸発させて、当該生成物を褐色の油状物として得た(収量: 0.6g)。

30

【0091】

その粗生成物をフラッシュクロマトグラフィーで精製して、0.22gの[2-(5-プロモピリミジン-2-イル)エチル]カルバミン酸t-ブチルを得た(16%)。

¹H NMR (CDCl₃): 8.76 (s, 2H); 5.22 (b, NH); 3.64 (m, 2H); 3.13 (m, 2H); 1.43 (s, 9H)。

【0092】

N-[2-(5-プロモピリミジン-2-イル)エチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(化合物(1))の合成

40

ジクロロメタン(2mL)中の[2-(5-プロモピリミジン-2-イル)エチル]カルバミン酸t-ブチル(0.22g, 0.7mmol)の透明な淡黄色の混合物に、トリフルオロ酢酸(10当量)を添加した。その混合物を室温で7時間攪拌し、一晩放置した。泡立ちが止むまで飽和重炭酸ナトリウム溶液を添加した(それにより、塩基性媒体が得られた)。濾過後、有機層を集め、MgSO₄で脱水し、減圧下に濃縮して、0.12gの2-(5-プロモプロモピリミジン-2-イル)エタンアミンを得た(80%)。これは、精製することなく直接使用される。

【0093】

THF(5mL)中の0.06gの2-(5-プロモプロモピリミジン-2-イル)エタンアミン(3.0mmol)及びトリエチルアミン(0.03g, 1.0当量)を室温

50

で攪拌しながら、それに、2 - トリフルオロメチルベンゾイルクロリド (0 . 0 6 2 g , 1 . 0 当量) を添加し、得られた混合物を室温で一晩攪拌した。減圧下に蒸発させることにより溶媒を除去し、飽和重炭酸ナトリウム (1 0 m L) を添加した。その混合物をジクロロメタンで抽出した。有機相を集め、M g S O ₄ で脱水し、減圧下に蒸発させて、粗生成物を得た。この粗生成物を、ヘプタン / 酢酸エチル (1 : 1) を使用するシリカゲルクロマトグラフィーで精製して、0 . 0 3 6 g の N - [2 - (5 - プロモピリミジン - 2 - イル) エチル] - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド (化合物 (A - 1)) を得た (3 2 %) 。

¹ H NMR (p p m , C D C l ₃) : 8 . 7 2 (s , 2 H) ; 8 . 7 4 - 8 . 5 7 (m , 4 H) ; 6 . 7 2 (b , N H) ; 3 . 9 4 (q , 2 H) ; 2 . 2 8 (m , 2 H)

10

質量スペクトル : [M + 1] = 3 7 4 。

【 0 0 9 4 】

一般式 (I) で表される化合物の生物学的活性についての実施例

実施例 A : アルテルナリア・ブラシカエ (*Alternaria brassicae*) (アブラナ科の植物の斑点病) に対するインビボ試験

被験活性成分を、ポッター均質化 (potter homogenisation) により、1 0 0 g / L の濃厚懸濁液型製剤として調製する。次いで、この懸濁液を水で希釈して、所望の活性物質濃度とする。

【 0 0 9 5 】

20

5 0 / 5 0 の泥炭土 - ポゾランの底土に播種し、1 8 ~ 2 0 で生育させたスターカップ (starter cup) 内のハツカダイコン植物 (品種 P e r n o t) を、子葉期で、上記水性懸濁液を噴霧することにより処理する。

【 0 0 9 6 】

対照として使用する植物は、活性物質を含んでいない水溶液で処理する。

【 0 0 9 7 】

2 4 時間経過した後、アルテルナリア・ブラシカエ (*Alternaria brassicae*) の胞子の水性懸濁液 (1 c m ³ 当たり 4 0 , 0 0 0 胞子) を噴霧することにより、該植物を汚染する。その胞子は、1 2 ~ 1 3 日間培養したものから採取する。

【 0 0 9 8 】

30

汚染されたハツカダイコン植物を、湿潤雰囲気下、約 1 8 で、6 ~ 7 日間インキュベートする。

【 0 0 9 9 】

上記汚染から 6 ~ 7 日間経過した後、対照植物と比較して、等級付けを行う。

【 0 1 0 0 】

これらの条件下、以下の化合物を 5 0 0 p p m の薬量で用いて、良好な結果 (少なくとも 5 0 %) が観察される : A 1 。

【 0 1 0 1 】

特許出願 W 0 0 1 / 1 1 9 6 5 により開示された N - { 1 - メチルカルバモイル - 2 - [3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジニル] エチル } - 4 - フェニルベンズアミド (表 D の化合物 3 1 6 を参照されたい。) は、3 3 0 p p m で、アルテルナリア・ブラシカエ (*Alternaria brassicae*) に対して不十分な効果しか示さず、また、ボトリチス・シネレア (*Botrytis cinerea*) に対しては全く効果を示さなかった。同様に、特許出願 W 0 0 1 / 1 1 9 6 5 により開示された N - { 1 - エチルカルバモイル - 2 - [3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジニル] エチル } - 3 - ニトロベンズアミド (表 D の化合物 3 0 7 を参照されたい。) も、3 3 0 p p m で、アルテルナリア・ブラシカエ (*Alternaria brassicae*) に対して不十分な効果しか示さず、また、ボトリチス・シネレア (*Botrytis cinerea*) に対しては全く効果を示さなかった。同様に、特許出願 W 0 0 1 / 1 1 9 6 5 により開示された N - { 1 - エチルカルバモイル - 2 - [3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジニル] エチル } - ベンズアミド及び N

40

50

- { 1 - メチルカルバモイル - 2 - [3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジニル] エチル } - ベンズアミド (表Dの化合物304及び化合物314を参照されたい。)も、330ppmで、ボトリチス・シネレア (Botrytis cinerea) に対して全く効果を示さなかった。同様に、特許出願W001/11965により開示されたN - { 1 - エチルカルバモイル - 2 - [3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジニル] エチル } - 4 - クロロベンズアミド、N - { 1 - エチルカルバモイル - 2 - [3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジニル] エチル } - 2 - プロモベンズアミド及びN - { 1 - メチルカルバモイル - 2 - [3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジニル] エチル } - 4 - メトキシベンズアミド (表Dの化合物306、化合物310及び化合物315を参照されたい。)も、330ppmで、ボトリチス・シネレア (Botrytis cinerea) に対して全く効果を示さなかった。

10

【0102】

特許出願W001/11965により開示されたN - { [3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジニル] メチル } - 5 - チエニルアセトアミド (表Bの化合物101を参照されたい。)は、330ppmで、アルテルナリア・ブラシカエ (Alternaria brassicae) に対して不十分な効果しか示さず、また、ボトリチス・シネレア (Botrytis cinerea) 及びペロノスポラ・パラシチカ (Peronospora parasitica) に対しては全く効果を示さなかった。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	
A 0 1 N 43/60	(2006.01)	A 0 1 N 43/60	
A 0 1 P 3/00	(2006.01)	A 0 1 P 3/00	
C 0 7 B 61/00	(2006.01)	C 0 7 B 61/00	3 0 0

- (72)発明者 マンスフィールド, ダレン
ドイツ国、5 1 4 2 9・ベルギシユ・グラートバハ、グラフ・アドルフ・シュトラセ・7
- (72)発明者 コクロン, ピエール・イブ
フランス国、エフ・6 9 0 0 3・リヨン、クール・ドウ・ラ・リベルテ、5 6
- (72)発明者 リーク, ハイコー
フランス国、エフ・6 9 1 1 0・サント・ホワイ・レ・リヨン、アレ・ビュフオン、2 9
- (72)発明者 デボルド, フィリップ
フランス国、エフ・6 9 0 0 7・リヨン、リュ・バンセル、3 0
- (72)発明者 ビリエ, アラン
フランス国、エフ・6 9 6 6 0・コローンジユ・オ・モン・ドール、シユマン・ドユ・シヤン、2
、レ・テール・ドウ・トゥールベオン、パテイマン・アー
- (72)発明者 グロジヤン・カールノワイエ, マリ・クレール
フランス国、エフ・6 9 2 5 0・キュリ・ゾ・モン・ドール、ルート・ダルビニー、ル・トレーブ
・コローンジユ
- (72)発明者 ジュニクス, ピエール
フランス国、エフ・6 9 0 0 4・リヨン、リュ・ドユピアル、1 4

審査官 砂原 一公

- (56)参考文献 特表2 0 0 3 - 5 0 6 4 6 5 (J P , A)
特開平0 1 - 1 5 1 5 4 6 (J P , A)
特開平1 1 - 3 0 2 2 6 1 (J P , A)
特開2 0 0 3 - 1 2 8 6 3 9 (J P , A)
国際公開第1 9 9 5 / 0 1 8 1 0 4 (W O , A 1)

- (58)調査した分野(Int.Cl. , D B名)
C07D 237/00-241/00
A01N 43/00-43/92
A01P 3/00
CAplus(STN)
REGISTRY(STN)