

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2005-511510

(P2005-511510A)

(43) 公表日 平成17年4月28日(2005.4.28)

(51) Int. Cl.<sup>7</sup>

C07D 237/32

A01N 43/58

F I

C O 7 D 237/32

A O 1 N 43/58

テーマコード (参考)

4 H O 1 1

E

審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全 41 頁)

(21) 出願番号	特願2003-528786 (P2003-528786)	(71) 出願人	302063961 バイエル・クロツプサイエンス・アクチエ ンゲゼルシャフト ドイツ40789モンハイム・アルフレー ト・ノバルーシユトラーセ50
(86) (22) 出願日	平成14年9月4日(2002.9.4)	(74) 代理人	100062007 弁理士 川口 義雄
(85) 翻訳文提出日	平成16年3月16日(2004.3.16)	(74) 代理人	100113332 弁理士 一入 章夫
(86) 国際出願番号	PCT/EP2002/009871	(74) 代理人	100114188 弁理士 小野 誠
(87) 国際公開番号	W02003/024938	(74) 代理人	100103920 弁理士 大崎 勝真
(87) 国際公開日	平成15年3月27日(2003.3.27)	(74) 代理人	100124855 弁理士 坪倉 道明
(31) 優先権主張番号	101 45 771.5		
(32) 優先日	平成13年9月17日(2001.9.17)		
(33) 優先権主張国	ドイツ(DE)		

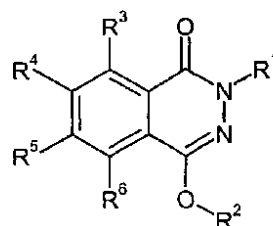
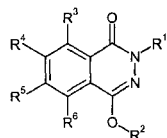
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 フタラジノンおよび望ましくない微生物を防除するためのそれらの使用

## (57) 【要約】

本発明は、式(I) (式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  は、本明細書中に挙げられている意味を有する) の化合物、それらの幾つかの製造法、および望ましくない微生物を防除するためのそれらの使用に関する。

## 【化1】



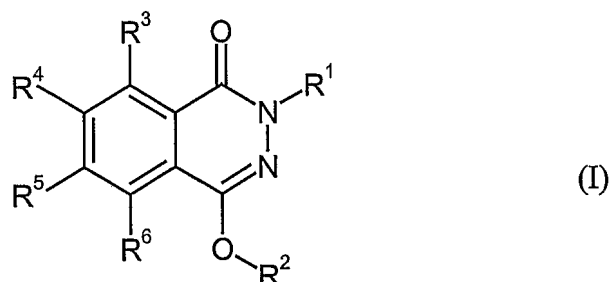
(I)

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

下記式 (I) :

## 【化 1】



10

(式中、

$R^1$  および  $R^2$  は、同じであり、または異なり、且つ、炭素原子を 2 個から 12 個有するアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキルまたはアルコシアルキルを、互いに無関係に表し、ならびに

$R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  は、同じであり、または異なり、且つ、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルケニル、アルケニルオキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルフィニル、ハロアルキルスルホニル、ハロアルケニルまたはハロアルケニルオキシ、ヒドロキシイミノアルキル、アルコキシイミノアルキルまたはシクロアルキルを互いに無関係に表し、

20

この場合、ラジカル  $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  のうちの少なくとも一つは、水素とは異なる)

の化合物。

## 【請求項 2】

$R^1$  および  $R^2$  が、同じであり、または異なり、且つ、各場合、炭素原子を 2 個から 12 個有する、アルキル、アルケニルまたはアルキニル、炭素原子を 3 個から 8 個有するシクロアルキル、シクロアルキル部分に炭素原子を 3 個から 8 個、アルキル部分に炭素原子を 1 個から 6 個有するシクロアルキルアルキル、または各場合、アルコキシ部分に炭素原子を 1 個から 6 個有する、アルコキシエチル、アルコキシプロピルまたはアルコキシブチルを、互いに無関係に表し、ならびに

30

$R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  が、同じであり、または異なり、且つ、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、

各場合、炭素原子を 1 個から 6 個有する、各場合、直鎖または分枝鎖の、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニルまたはアルキルスルホニル；

各場合、炭素原子を 2 個から 6 個有する、各場合、直鎖または分枝鎖の、アルケニルまたはアルケニルオキシ；

各場合、炭素原子を 1 個から 6 個、および同じまたは異なるハロゲン原子を 1 個から 3 個有する、各場合、直鎖または分枝鎖の、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルフィニルまたはハロアルキルスルホニル；

40

各場合、炭素原子を 2 個から 6 個、および同じまたは異なるハロゲン原子を 1 個から 1 個有する、各場合、直鎖または分枝鎖の、ハロアルケニルまたはハロアルケニルオキシ；

炭素原子を 1 個から 6 個有するヒドロキシイミノアルキル；

炭素原子を 2 個から 6 個有するアルコキシイミノアルキル；または

炭素原子を 3 個から 6 個有するシクロアルキル

を互いに無関係に表し、

この場合、ラジカル  $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  のうちの少なくとも一つは、水素とは

50

異なる、請求項 1 に記載の式 ( I ) の化合物。

【請求項 3】

$R^1$  および  $R^2$  が、同じであり、または異なり、且つ、各場合、直鎖または分枝鎖の、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウンデシルまたはドデシル；エテニル、プロベニル、ブテニル、ペンテニル、ヘキセニル、ヘプテニル、オクテニル、ノネニル、デセニル、ウンデセニルまたはドデセニル；エチニル、プロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、ヘプチニル、オクチニル、ノニニル、デシニル、ウンデシニル、ドデシニル、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、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、シクロプロピルエチル、シクロブチルエチル、シクロペンチルエチル、シクロヘキシルエチル、メトキシエチル、エトキシエチル、メトキシプロピルまたはメトキシブチルを、互いに無関係に表し、これらは、各々、どの位置で結合していてもよく；ならびに

10

$R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  が、同じであり、または異なり、且つ、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、*n*-または *i*-プロピル、*n*-、*i*-、*s*-または *t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、*n*-または *i*-プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、*n*-または *i*-ピロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルまたはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、フルオロジクロロメチル、トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルまたはトリフルオロメチルスルホニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、ヒドロキシイミノメチル、ヒドロキシイミノエチル、メトキシイミノメチル、エトキシイミノメチル、メトキシイミノエチルまたはエトキシイミノエチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルを、互いに無関係に表し、

20

この場合、ラジカル  $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  のうちの少なくとも一つは、水素とは異なる、請求項 1 に記載の式 ( I ) の化合物。

【請求項 4】

$R^1$  が、直鎖または分枝鎖の、メチル、エチル、プロピル、ブチル、エテニル、プロベニル、ブテニル、エチニル、プロピニル、ブチニル、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、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチルまたはメトキシエチルを表し、これらは、各々、どの位置で結合していてもよく、

30

$R^2$  が、直鎖または分枝鎖の、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、エテニル、プロベニル、ブテニル、エチニル、プロピニル、ブチニル、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、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチルまたはメトキシエチルを表し、これらは、各々、どの位置で結合していてもよく、

$R^3$  が、水素を表し、

40

$R^4$  が、水素、*n*-プロポキシ、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を表し、

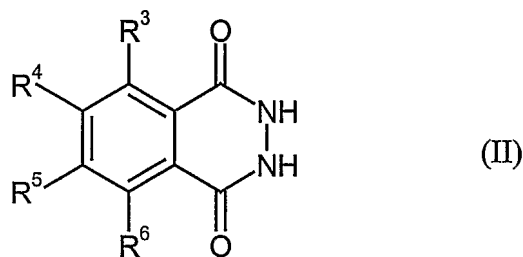
$R^5$  が、水素、*n*-プロポキシ、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を表し、

$R^6$  が、水素を表す、請求項 1 に記載の式 ( I ) の化合物。

【請求項 5】

a) 下記式 ( I I ) :

【化 2】



(この式中、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  は、請求項 1 において定義したとおりである) 10  
 のフタラジンジオンを、下記式 (III) :

【化 3】



(この式中、

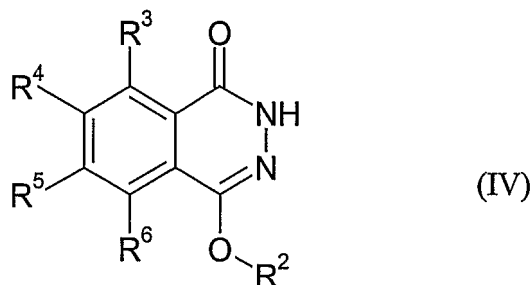
R は、請求項 1 において  $R^1$  および  $R^2$  に与えた意味を有し、ならびに

X は、脱離基、好ましくは、ハロゲン、アルキルスルホニルまたはアリールスルホニルを表す)

のアルキル誘導体と、適切な場合には酸受容体の存在下で、および適切な場合には希釈剤 20  
 の存在下で、反応させること、または

b) 下記式 (IV) :

【化 4】



30

(この式中、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  は、請求項 1 において定義したとおりである)

のアルキルフタラジノンを、下記式 (III) :

【化 5】



(この式中、

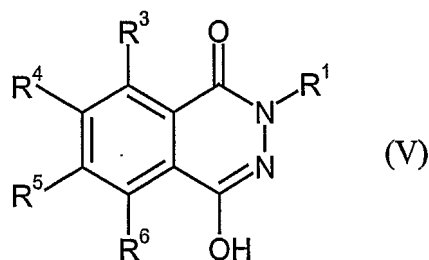
R は、請求項 1 において  $R^1$  に与えた意味を有し、および

X は、請求項 1 において定義したとおりである)

のアルキル誘導体と、適切な場合には酸受容体の存在下で、および適切な場合には希釈剤 40  
 の存在下で、反応させること、または

c) 下記式 (V) :

【化 6】



10

(この式中、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  は、請求項 1 において定義したとおりである)

のヒドロキシフタラジノンを、下記式 (III) :

【化 7】



(この式中、

$R$  は、請求項 1 において  $R^2$  に与えた意味を有し、および

$X$  は、請求項 1 において定義したとおりである)

20

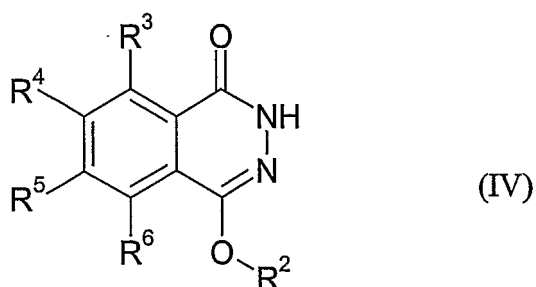
のアルキル誘導体と、適切な場合には酸受容体の存在下で、および適切な場合には希釈剤の存在下で、反応させること

を特徴とする、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物の調製法。

【請求項 6】

下記式 (IV) :

【化 8】



30

(式中、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  は、請求項 1 から 4 のいずれかにおいて与えた意味のうちの一つを有する)

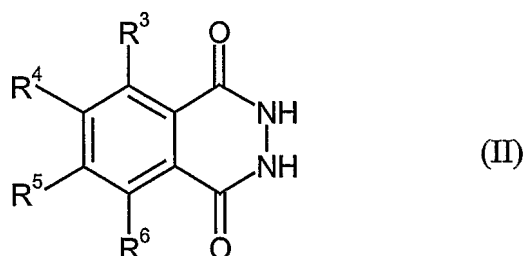
の化合物。

【請求項 7】

d) 下記式 (II) :

40

【化 9】



(式中、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  は、請求項 1 において定義したとおりである)

50

のフタラジンジオンを、下記式 (III) :

【化 1 0】



(この式中、

R は、請求項 1 において R<sup>2</sup> に与えた意味を有し、および

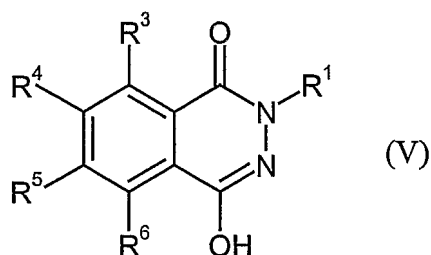
X は、脱離基、好ましくは、ハロゲン、アルキルスルホニルまたはアリアルスルホニルを表す)

のアルキル誘導体と、適切な場合には酸受容体の存在下で、および適切な場合には希釈剤の存在下で、反応させることを特徴とする、請求項 6 に記載の式 (IV) の化合物の調製法。

【請求項 8】

下記式 (V) :

【化 1 1】



20

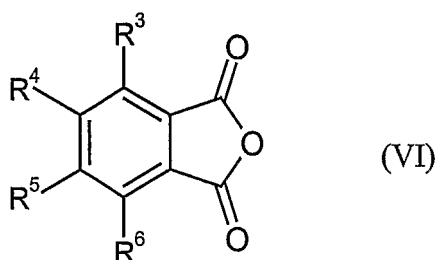
(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は、請求項 1 から 4 のいずれかにおいて与えた意味のうちの一つを有する)

の化合物。

【請求項 9】

e) 下記式 (VI) :

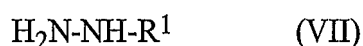
【化 1 2】



30

(式中、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は、請求項 1 において定義したとおりである) の無水フタル酸を、下記式 (VII) :

【化 1 3】



40

(式中、R<sup>1</sup> は、請求項 1 において定義したとおりである)

のヒドラジン誘導体またはその塩と、適切な場合は希釈剤の存在下で、および適切な場合には塩の存在下で、反応させることを特徴とする、請求項 8 に記載の式 (V) の化合物の調製法。

【請求項 10】

請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の式 (I) または請求項 6 に記載の式 (IV) または請求項 8 に記載の式 (V) の化合物を少なくとも一つ含むことを特徴とする有害生物

50

防除剤。

【請求項 1 1】

有害生物を防除するための、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の式 ( I ) または請求項 6 に記載の式 ( I V ) または請求項 8 に記載の式 ( V ) の化合物の使用。

【請求項 1 2】

請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の式 ( I ) または請求項 6 に記載の式 ( I V ) または請求項 8 に記載の式 ( V ) の化合物を、有害生物および / またはそれらの生息場所に作用させることを特徴とする有害生物防除法。

【請求項 1 3】

請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の式 ( I ) または請求項 6 に記載の式 ( I V ) または請求項 8 に記載の式 ( V ) の化合物を、増量剤および / または界面活性剤と混合することを特徴とする、有害生物防除剤の調製法。

10

【請求項 1 4】

有害生物防除剤を調製するための、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の式 ( I ) または請求項 6 に記載の式 ( I V ) または請求項 8 に記載の式 ( V ) の化合物の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規フトラジノン、それらを調製するための多数の方法、および望ましくない微生物を防除するためのそれらの使用に関する。

20

【背景技術】

【0002】

一定のフトラジノンが殺真菌特性を有することは、既に知られている (例えば、特開平 08 - 198856 を比較)。これらの化合物の活性は良好であるが、塗布率が低いと、活性が不十分な場合もある。

【発明の開示】

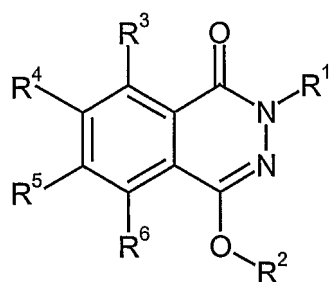
【0003】

今般、本発明は、下記式 ( I ) :

【0004】

【化 1】

30



(I)

(式中、

40

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、同じであり、または異なり、且つ、炭素原子を 2 個から 12 個有するアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキルまたはアルコキシアルキルを互いに無関係に表し、ならびに

R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は、同じであり、または異なり、且つ、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルケニル、アルケニルオキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルフィニル、ハロアルキルスルホニル、ハロアルケニルまたはハロアルケニルオキシ、ヒドロキシイミノアルキル、アルコキシイミノアルキルまたはシクロアルキルを互いに無関係に表し、

この場合、ラジカル R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> のうちの少なくとも一つは、水素とは

50

異なる)

の新規フタラジノンを提供する。

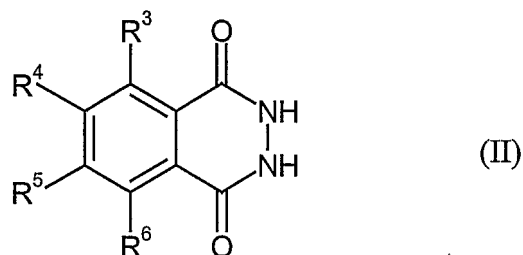
【0005】

さらに、上記式(I)のフタラジノンは、

a) 下記式(II)：

【0006】

【化2】



10

(この式中、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  は、上で定義したとおりである)  
のフタラジンジオンを、下記式(III)：

【0007】

【化3】



20

(この式中、

Rは、上で $R^1$  および  $R^2$  に与えた意味を有し、ならびに

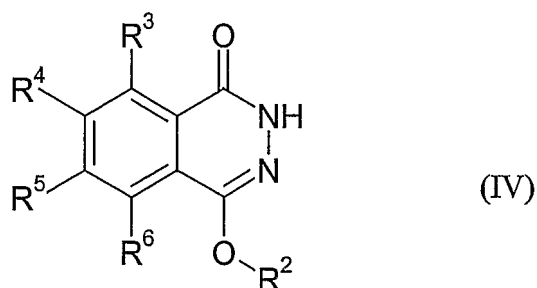
Xは、脱離基、好ましくは、ハロゲン、アルキルスルホニルまたはアリールスルホニルを表す)

のアルキル誘導体と、適切な場合には酸受容体の存在下で、および適切な場合には希釈剤の存在下で、反応させると、または

b) 下記式(IV)：

【0008】

【化4】



40

(この式中、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  は、上で与えた、および下で与える意味を有する)

のアルキルフタラジノンを、下記式(III)：

【0009】

【化5】



(この式中、

50



R は、上で R<sup>1</sup> に与えた意味を有し、および

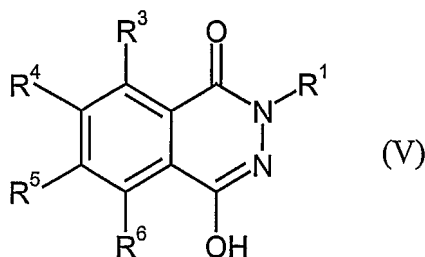
X は、上で定義したとおりである)

のアルキル誘導体と、適切な場合には酸受容体の存在下で、および適切な場合には希釈剤の存在下で、反応させると、または

c) 下記式 (V) :

【0010】

【化6】



10

のヒドロキシフタラジノンを、下記式 (III) :

【0011】

【化7】



20

(この式中、

R は、上で R<sup>2</sup> に与えた意味を有し、および

X は、上で定義したとおりである)

のアルキル誘導体と、適切な場合には酸受容体の存在下で、および適切な場合には希釈剤の存在下で、反応させると得られることがわかった。

【0012】

本発明の化合物は、適切な場合には、異なる可能な異性体形の混合物、特に、例えば E と Z、トレオとエリトロなどの立体異性体の混合物として存在し得り、光学異性体の混合物としても、適切な場合には互変異性体または位置異性体の混合物としても、存在し得る。特許請求するのは、E および Z 両方の異性体、ならびにトレオおよびエリトロ、ならびにまた、光学異性体、可能な位置異性体、これらの異性体のあらゆる混合物、ならびに可能な互変異性体形である。

30

【0013】

最後に、上記式 (I) の新規フタラジノンは、非常に良好な殺微生物特性を有し、作物の保護および材料の保護の両方において望ましくない微生物を防除するために使用できることがわかった。驚くべきことに、本発明の式 (I) のフタラジノンは、構造的に最も類似した先行技術の活性化合物の同じ方面の作用よりかなり良好な殺真菌活性を有する。

【0014】

上で与えた、および下で与える式の中に挙げられているラジカルの置換基または範囲の特定の意味を下に説明する：

40

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、同じであり、または異なり、且つ、各場合、炭素原子を 2 個から 12 個有する、アルキル、アルケニルまたはアルキニル、炭素原子を 3 個から 8 個有するシクロアルキル、シクロアルキル部分に炭素原子を 3 個から 8 個、アルキル部分に炭素原子を 1 個から 6 個有するシクロアルキルアルキル、または各場合、アルコキシ部分に炭素原子を 1 個から 6 個有する、アルコキシエチル、アルコキシプロピルまたはアルコキシブチルを、互いに無関係に、好ましくは表す。

【0015】

R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は、同じであり、または異なり、且つ、水素、ハロゲン、

50

シアノ、ニトロ、

各場合、炭素原子を1個から6個有する、各場合、直鎖または分枝鎖の、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニルまたはアルキルスルホニル；

各場合、炭素原子を2個から6個有する、各場合、直鎖または分枝鎖の、アルケニルまたはアルケニルオキシ；

各場合、炭素原子を1個から6個、および同じまたは異なるハロゲン原子を1個から13個有する、各場合、直鎖または分枝鎖の、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルフィニルまたはハロアルキルスルホニル；

各場合、炭素原子を2個から6個、および同じまたは異なるハロゲン原子を1個から11個有する、各場合、直鎖または分枝鎖の、ハロアルケニルまたはハロアルケニルオキシ；

炭素原子を1個から6個有するヒドロキシイミノアルキル；

炭素原子を2個から6個有するアルコキシイミノアルキル；または

炭素原子を3個から6個有するシクロアルキル

を互いに無関係に、好ましくは表し、

この場合、ラジカル $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ および $R^6$ のうちの少なくとも一つは、水素とは異なる。

【0016】

$R^1$  および  $R^2$  は、同じであり、または異なり、且つ、各場合、直鎖または分枝鎖の、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウンデシルまたはドデシル；エテニル、プロベニル、ブテニル、ペンテニル、ヘキセニル、ヘプテニル、オクテニル、ノネニル、デセニル、ウンデセニルまたはドデセニル；エチニル、プロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、ヘプチニル、オクチニル、ノニニル、デシニル、ウンデシニル、ドデシニル、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、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、シクロプロピルエチル、シクロブチルエチル、シクロペンチルエチル、シクロヘキシルエチル、メトキシエチル、エトキシエチル、メトキシプロピルまたはメトキシブチルを、互いに無関係に、特に好ましくは表し、これらは、各々、どの位置で結合していてもよい。

【0017】

$R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  は、同じであり、または異なり、且つ、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、 $n$ -または  $i$ -プロピル、 $n$ -、 $i$ -、 $s$ -または  $t$ -ブチル、メトキシ、エトキシ、 $n$ -または  $i$ -プロポキシ、メチルチオ、エチルチオ、 $n$ -または  $i$ -ピロピルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メチルスルホニルまたはエチルスルホニル、トリフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、フルオロジクロロメチル、トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリフルオロエトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニルまたはトリフルオロメチルスルホニル、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、ヒドロキシイミノメチル、ヒドロキシイミノエチル、メトキシイミノメチル、エトキシイミノメチル、メトキシイミノエチルまたはエトキシイミノエチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルを、互いに無関係に、特に好ましくは表し、

この場合、ラジカル $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  のうちの少なくとも一つは、水素とは異なる。

【0018】

$R^1$  は、特に非常に好ましくは、直鎖または分枝鎖の、メチル、エチル、プロピル、ブチル、エテニル、プロベニル、ブテニル、エチニル、プロピニル、ブチニル、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、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチルまたはメトキシエチルを表

10

20

30

40

50

し、これらは、各々、どの位置で結合していてもよい。

【0019】

R<sup>2</sup> は、特に非常に好ましくは、直鎖または分枝鎖の、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、エテニル、プロペニル、ブテニル、エチニル、プロピニル、ブチニル、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、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチルまたはメトキシエチルを表し、これらは、各々、どの位置で結合していてもよい。

【0020】

R<sup>3</sup> は、特に非常に好ましくは、水素を表す。

【0021】

R<sup>4</sup> は、特に非常に好ましくは、水素、n-プロポキシ、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を表す。

【0022】

R<sup>5</sup> は、特に非常に好ましくは、水素、n-プロポキシ、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を表す。

【0023】

R<sup>6</sup> は、特に非常に好ましくは、水素を表す。

【0024】

アルキルまたはアルケニルなどの飽和または不飽和炭化水素ラジカルは、各場合、それが可能であるかぎり、直鎖であってもよいし、分枝鎖であってもよく、例えば、アルコキシまたはヒドロキシミノアルキルのなどの場合のようにヘテロ原子と組合せたものを含む。別様に指示されていない限り、炭素原子数1~6の炭素鎖が好ましい。

【0025】

例えばハロアルキルなどの、ハロゲン置換ラジカルは、一または多ハロゲン化されている。多ハロゲン化の場合、ハロゲン原子は、同じであってもよいし、異なってもよい。別様に指示されていない限り、炭素原子数1~6の炭素鎖が好ましい。

【0026】

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素、特に好ましくは、フッ素、塩素および臭素を表す。

【0027】

シクロアルキルは、飽和炭素環式化合物を表し、それらは、融合したまたは架橋したさらなる炭素環を有する多環式環構造を形成していてもよい。別様に指示されていない限り、炭素原子を3個から6個有する炭素環が好ましい。

【0028】

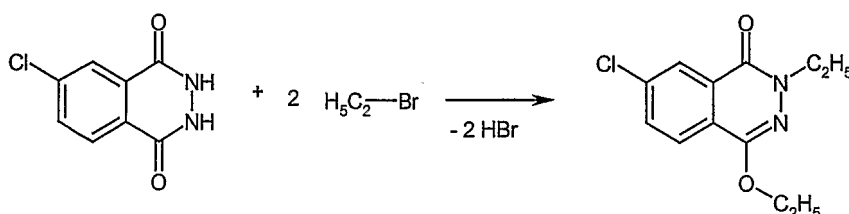
しかし、一般に、上に挙げた好ましいまたは特に好ましいラジカルの定義または説明は、所望される場合には、互いに、すなわち、それぞれの範囲と好ましい範囲の間で、組合せることもできる。これらの定義は、最終生成物にも、それに対応して前駆体および中間体にも、あてはまる。さらに、個々の定義があてはまらないこともある。

【0029】

本発明の方法 a) は、下の反応式によって説明することができる：

【0030】

【化8】



10

20

30

40

50

## 【0031】

式(II)は、本発明の方法a)を行うための出発材料として必要なフタラジンジオンの一般定義を提供するものである。この式(II)において、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ および $R^6$ は、本発明の式(I)の化合物の説明に関連して、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ および $R^6$ に好ましい、特に好ましい、または特に非常に好ましいと既に述べた意味を、好ましくは、または特に好ましくは有する。式(II)のフタラジンジオンは、既知であり、既知の方法(例えば、B. J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1 (1980), (8), 1834-40を比較)によって調製することができる。

## 【0032】

式(III)は、本発明の方法a)を行うための出発材料として必要なアルキル誘導体の一般定義を提供するものである。この式(III)において、Rは、本発明の式(I)の化合物の説明に関連して、 $R^1$ または $R^2$ に好ましいまたは特に好ましいものとして既に与えた意味を、好ましくは、または特に好ましくは有する。Xは、ハロゲン、好ましくは臭素またはヨウ素、を表すか、アルキルスルホニル、好ましくはメチルスルホニルを表すか、アリールスルホニル、好ましくは4-トリルスルホニルを表す。式(III)のアルキル誘導体は、既知合成化学薬品である。

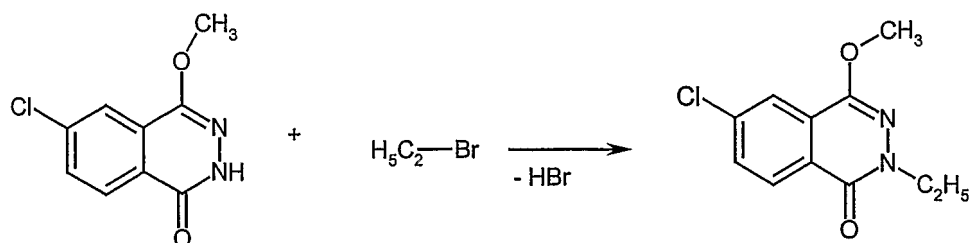
10

## 【0033】

本発明の方法b)は、下の反応式によって説明することができる：

## 【0034】

## 【化9】



20

## 【0035】

式(IV)は、本発明の方法b)を行うための出発材料として必要なアルキルフタラジンジオンの一般定義を提供するものである。この式(IV)において、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ および $R^6$ は、本発明の式(I)の化合物の説明に関連して、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ および $R^6$ に好ましい、または特に好ましいと既に述べた意味を、好ましくは有する。

30

## 【0036】

式(IV)のアルキルフタラジンジオンは新規であり、本出願の主題の一部を成すものである。さらに、式(IV)の新規アルキルフタラジンジオンも非常に良好な殺微生物特性を有し、且つ、作物保護および材料の保護の両方において望ましくない微生物を防除するために使用できることがわかった。

## 【0037】

これらは、(方法d)式(II)のフタラジンジオンを式(III)のアルキル誘導体と、適切な場合には酸受容体の存在下で、および適切な場合には希釈剤の存在下で反応させると得られる。

40

## 【0038】

本発明の方法d)を行うための出発原料として必要な式(II)のフタラジンジオンは、本発明の方法a)の説明に関連して、既に上でさらに説明している。

## 【0039】

本発明の方法b)およびd)を行うための出発原料としてさらに必要な式(III)のアルキル誘導体は、本発明の方法a)の説明に関連して、既に上でさらに説明している。

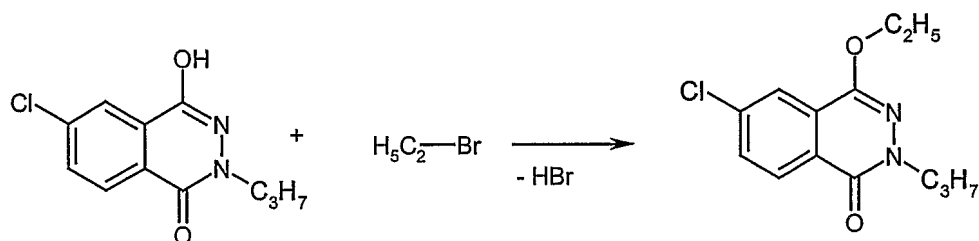
## 【0040】

50

本発明の方法 c ) は、下の反応式によって説明することができる：

【 0 0 4 1 】

【 化 1 0 】



10

【 0 0 4 2 】

本発明の方法 c ) を行うための出発原料としてさらに必要な式 ( I I I ) のアルキル誘導体は、本発明の方法 a ) の説明に関連して、既に上でさらに説明している。

【 0 0 4 3 】

式 ( V ) は、本発明の方法 c ) を行うための出発原料としてさらに必要なヒドロキシフタラジノンの一般定義を提供するものである。この式 ( V ) において、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  は、本発明の式 ( I ) の化合物の説明に関連して、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  に好ましい、または特に好ましいと既に述べた意味を、好ましくは有する。

20

【 0 0 4 4 】

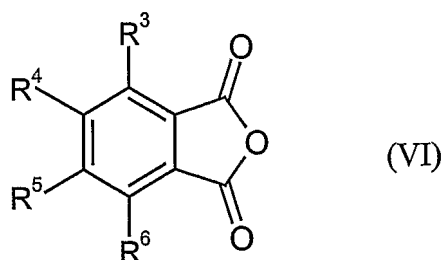
式 ( V ) のヒドロキシフタラジノンは新規であり、本出願の主題の一部を成すものである。さらに、式 ( V ) の新規ヒドロキシフタラジノンも非常に良好な殺微生物特性を有し、且つ、作物保護および材料の保護の両方において望ましくない微生物を防除するために使用できることがわかった。

【 0 0 4 5 】

それらは、(方法 e) 下記式 ( V I ) :

【 0 0 4 6 】

【 化 1 1 】



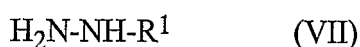
(VI)

30

(この式中、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  は、上で定義したとおりである) の無水フタル酸を、下記式 ( V I I ) :

【 0 0 4 7 】

【 化 1 2 】



40

(この式中、 $R^1$  は、上で定義したとおりである) のヒドラジン誘導体またはその塩と、適切な場合には希釈剤の存在下で、および適切な場合には塩の存在下で反応させると得られる。

【 0 0 4 8 】

式 ( V ) のヒドロキシフタラジノンを方法 e ) に従って調製すると、各場合、二つの位置異性体の混合物が、多くの場合に得られる。これらの混合物は、個々の成分に分離せず

50

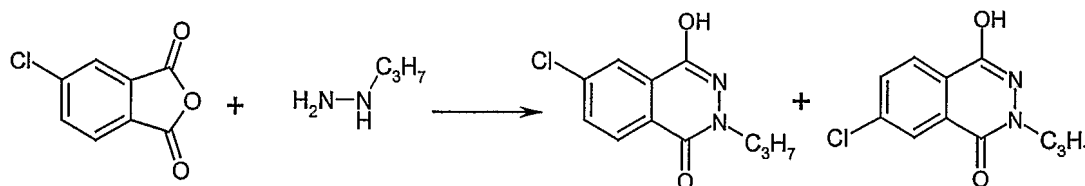
とも、方法 c ) に従って式 ( I ) の化合物を調製するための出発原料として使用することができる。

【 0 0 4 9 】

本発明の方法 e ) は、下の反応式によって説明することができる：

【 0 0 5 0 】

【 化 1 3 】



10

【 0 0 5 1 】

式 ( V I ) は、本発明の方法 e ) を行うための出発原料として必要な無水フタル酸の一般定義を提供するものである。この式 ( V I ) において、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  は、本発明の式 ( I ) の化合物の説明に関連して、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  に好ましい、または特に好ましいと既に述べた意味を、好ましくは有する。式 ( V I ) の無水フタル酸は既知であり、既知の方法 (例えば、*J. Chem. Soc., Perkin Trans. I* 1980, 1834 - 1840 を比較) によって得ることができる。

【 0 0 5 2 】

式 ( V I I ) は、本発明の方法 e ) を行うための出発原料としてさらに必要なヒドラジン誘導体の一般定義を提供するものである。この式 ( V I I ) において、 $R^1$  は、本発明の式 ( I ) の化合物の説明に関連して、 $R^1$  に好ましい、または特に好ましいと既に述べた意味を、好ましくは有する。ヒドラジン誘導体の塩を使用する場合、塩酸塩および硫酸水素塩が好ましい。式 ( V I I ) のヒドラジン誘導体およびそれらの塩は既知であり、既知の方法 (例えば、*J. Synth. Commun.* 1995, 3805 - 3812 を比較) によって得ることができる。

20

【 0 0 5 3 】

本発明の方法 a )、b )、c )、d ) および e ) を行うために適する希釈剤は、水およびすべての不活性有機溶媒である。これらには、好ましくは、例えば、石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンまたはデカリンなどの脂肪族、脂環式または芳香族炭化水素；例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタンまたはトリクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル - t - ブチルエーテル、メチル - t - アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2 - ジメトキシエタン、1,2 - ジエトキシエタンまたはアニソールなどのエーテル；アセトン、ブタノン、メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサノンなどのケトン；アセトニトリル、プロピオニトリル、n - または i - ブチロニトリルまたはベンゾニトリルなどのニトリル；N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセトアミド、N - メチルホルムアニリド、N - メチルピロリドンまたはヘキサメチルリン酸トリアミドなどのアミド；酢酸メチルまたは酢酸エチルなどのエステル；ジメチルスルホキシドなどのスルホキシド；スルホランなどのスルホン；メタノール、エタノール、n - または i - プロパノール、n -、i -、s - または t - ブタノール、エタンジオール、プロパン - 1, 2 - ジオール、エトキシエタノール、メトキシエタノール、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノエチルエーテルなどのアルコール、それらと水の混合物が挙げられる。

30

40

【 0 0 5 4 】

本発明の方法 a )、b )、c ) および d ) は、適切な場合には、適する酸受容体の存在下で行う。適切な酸受容体とは、通例の無機または有機塩基すべてである。これらには、好ましくは、例えば、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、リチウムジイソプロピルア

50

ミド、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、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、酢酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸カリウム、重炭酸ナトリウムまたは炭酸アンモニウムなどのアルカリ土類金属またはアルカリ金属の水素化物、水酸化物、アミド、アルコキシド、酢酸塩、炭酸塩または重炭酸塩、およびまた、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、*N,N*-ジメチルアニリン、*N,N*-ジメチル-ベンジルアミン、ピリジン、*N*-メチル-ピペリジン、*N*-メチルモルホリン、*N,N*-ジメチルアミノピリジン、ジアザビシクロオクタン(DABCO)、ジアザビシクロノネン(DBN)またはジアザビシクロウンデセン(DBU)などの第三アミンが挙げられる。

**【0055】**

本発明の方法 a)、b)、c) および d) を行う際の反応温度は、比較的広い範囲で変化させることができる。一般に、これらの方法は、-20 から 150 の温度、好ましくは -10 から 80 の温度で行う。

**【0056】**

式(I)の化合物を調製するために本発明の方法 a) を行うには、一般に 2 mol から 15 mol、好ましくは 2 mol から 5 mol の式(III)のアルキル誘導体を、式(II)のフタラジジオン 1 mol に対して使用する。

**【0057】**

式(I)の化合物を調製するために本発明の方法 b) を行うには、一般に 1 mol から 10 mol、好ましくは 1 mol から 5 mol の式(III)のアルキル誘導体を、式(IV)のアルキルフタラジノン 1 mol に対して使用する。

**【0058】**

式(I)の化合物を調製するために本発明の方法 c) を行うには、一般に 1 mol から 15 mol、好ましくは 1 mol から 8 mol の式(III)のアルキル誘導体を、式(V)のヒドロキシフタラジノン 1 mol に対して使用する。

**【0059】**

式(IV)の化合物を調製するために本発明の方法 d) を行うには、一般に 1 mol から 2 mol、好ましくは 1 mol から 5 mol の式(III)のアルキル誘導体を、式(II)のフタラジジオン 1 mol に対して使用する。

**【0060】**

本発明の方法 e) を行うために適する希釈剤は、不活性有機溶媒である。これらには、好ましくは、例えば、石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンまたはデカリンなどの脂肪族、脂環式または芳香族炭化水素；例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタンまたはトリクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル-*t*-ブチルエーテル、メチル-*t*-アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、1,2-ジエトキシエタンまたはアニソールなどのエーテル、およびまた、酢酸などのカルボン酸が挙げられる。

**【0061】**

本発明の方法 e) は、適切な場合には、塩の存在下で行う。適する塩は、好ましくは、例えば酢酸ナトリウムなどの酢酸塩である。

**【0062】**

本発明の方法 e) を行う際の反応温度は、比較的広い範囲で変化させることができる。一般に、この方法は、0 から 200 の温度、好ましくは 20 から 120 の温度で行う。

**【0063】**

式(I)の化合物を調製するために本発明の方法 e) を行うには、一般に 1 mol から 15 mol、好ましくは 1 mol から 8 mol の式(VII)のヒドラジン誘導体を、式(VI)の無水フタル酸 1 mol に対して使用する。

10

20

30

40

50

## 【0064】

本発明のすべての方法は、一般には大気圧下で行う。しかし、高圧または減圧下（一般に0.1barと10barの間）で操作することもできる。

## 【0065】

本発明の化合物は、強い殺微生物活性を有し、且つ、作物保護および材料の保護の両方において、真菌および細菌などの望ましくない微生物を防除するために（有害生物防除剤として）使用することができる。

## 【0066】

殺真菌薬は、作物保護において、ネコブカビ類（*Plasmodiophoromycetes*）、卵菌類（*Oomycetes*）、ツボカビ類（*Chytridiomycetes*）、接合菌類（*Zygomycetes*）、子囊菌類（*Ascomycetes*）、担子菌類（*Basidiomycetes*）および不完全菌類（*Deuteromycetes*）を防除するために使用することができる。

## 【0067】

殺菌薬は、作物保護において、シュードモナス科（*Pseudomonadaceae*）、リゾビウム科（*Rhizobiaceae*）、腸内細菌科（*Enterobacteriaceae*）、コレネバクレリウム科（*Corynebacteriaceae*）およびストレプトマイセス科（*Streptomycetaceae*）を防除するために使用することができる。

## 【0068】

上に挙げた一般名に入る、真菌性および細菌性病を生じるいくつかの病原体には、限定としてではなく、例として以下のものを挙げるることができる：

ザントモナス（*Xanthomonas*）種：例えば、イネ白葉枯病菌（*Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*）など；

シュードモナス（*Pseudomonas*）種：例えば、斑点細菌病菌（*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*）など；

エルウィニア（*Erwinia*）種：例えば、エルウィニア・アミロポーラ（*Erwinia amylovora*）など；

クサレカビ属（*Pythium*）種：例えば、ピシウム・ウルチマム（*Pythium ultimum*）など；

疫病菌（*Phytophthora*）種：例えば、ジャガイモ疫病菌（*Phytophthora infestans*）など；

シュードペロノスポラ属（*Pseudoperonospora*）種：例えば、褐斑病菌（*Pseudoperonospora humuli*）またはウリ科べと病菌（*Pseudoperonospora cubensis*）など；

タンジクツユカビ属（*Plasmopara*）種：例えば、ブドウべと病菌（*Plasmopara viticola*）など；

ブレミア（*Bremia*）種：例えば、レタスべと病菌（*Bremia lactucae*）など；

ツユカビ属（*Peronospora*）種：例えば、ペロノスポラ・ピシ（*Peronospora pisi*）またはペロノスポラ・ブラッシカ（*P. brassicae*）など；

ウドンコカビ属（*Erysiphae*）種：例えば、コムギうどんこ病菌（*Erysiphae graminis*）など；

スファエロセカ属（*Sphaerotheca*）種：例えば、キュウリうどんこ病菌（*Sphaerotheca fuliginea*）など；

ロドスフェラ属（*Podosphaera*）種：例えば、リンゴうどんこ病菌（*Podosphaera leucotricha*）など；

ベンチュリア属（*Venturia*）種：例えば、リンゴ黒星病菌（*Venturia inaequalis*）など；

10

20

30

40

50



ピレノフォラ属 (*Pyrenophora*) 種：例えば、網班病菌 (*Pyrenophora teres*) または班葉病菌 (*P. graminea*) (分生子形：ドレクスレラ属 (*Drechslera*)、別名：ヘルミントスポリウム属 (*Helminthosporium*)) など；

コリオボラス属 (*Cochliobolus*) 種：例えば、イネ科斑点病菌 (*Cochliobolus sativus*) (分生子形：ドレクスレラ属 (*Drechslera*)、別名：ヘルミントスポリウム属 (*Helminthosporium*)) など；

ウロミケス属 (*Uromyces*) 種：例えば、さび菌 (*Uromyces appendiculatus*) など；

ブクキニア属 (*Puccinia*) 種：例えば、コムギ赤さび病菌 (*Puccinia recondita*) など；

スクレロティニア属 (*Sclerotinia*) 種：例えば、菌核病菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*) など；

チレットィア (*Tilletia*) 種：例えば、コムギなまぐさ黒穂病菌 (*Tilletia caries*) など；

黒穂菌属 (*Ustilago*) 種：例えば、オオムギ、コムギ裸黒穂病菌 (*Ustilago nuda*) またはエンバク裸黒穂病菌 (*Ustilago avenae*) など；

ペリキュラリア (*Pellicularia*) 種：例えば、ササキクモノコウヤクタケ (*Pellicularia sasakii*) など；

ピリキュラリア属 (*Pyricularia*) 種：例えば、イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) など；

フザリウム属 (*Fusarium*) 種：例えば、フザリウム・クルモラム (*Fusarium culmorum*) など；

ボトリチス属 (*Botrytis*) 種：例えば、灰色かび病菌 (*Botrytis cinerea*) など；

セプトリア属 (*Septoria*) 種：例えば、コムギふ枯病菌セプトリア・ノトラム (*Septoria nodorum*) など；

レプトスフェリア属 (*Leptosphaeria*) 種：例えば、コムギふ枯病菌レプトスフェリア・ノドラム (*Leptosphaeria nodorum*) など；

セルコスポラ属 (*Cercospora*) 種：例えば、セルコスポラ・カネッセス (*Cercospora canescens*) など；

アルテルナリア属 (*Alternaria*) 種：例えば、アブラナ科黒斑病菌 (*Alternaria brassicae*) など；および

シュードセルコスポレラ属 (*Pseudocercospora*) 種：例えば、コムギ眼紋病菌 (*Pseudocercospora herpotrichoides*) など。

#### 【0069】

本発明の活性化合物は、強い植物強壮作用も示す。従って、これらは、望ましくない微生物による攻撃に対する植物の内在的防御を起動させるために適する。

#### 【0070】

本文脈において、植物強壮 (耐性誘導性) 化合物は、処理した植物に、その後、望ましくない微生物を実質的に接種した時、前記植物がこれらの微生物に対して実質的な耐性を発生するように、前記植物の防御システムを刺激することができる物質を意味するとご理解いただきたい。

#### 【0071】

この場合、望ましくない微生物は、植物寄生病原性真菌、細菌およびウイルスを意味するとご理解いただきたい。それ故、本発明の化合物は、処理後一定期間内は、上述の病原体による攻撃から植物を保護するために使用することができる。この保護が得られる期間

10

20

30

40

50

は、本活性化合物で植物を処理してから一般には1日から10日、好ましくは1日から7日に及ぶ。

【0072】

本活性化合物が、植物の病気を防御するために必要な濃度で、植物に充分許容されるということから、植物の地上部分の処理、繁殖用貯蔵物および種子の処理、ならびに土壤の処理が可能となる。

【0073】

本発明の活性化合物は、穀類の病気を制御するために、例えばエリシフェ属 (*Erysiphe*) 種などに対して使用すると、ならびにブドウ栽培、果物および野菜栽培における病気を制御するために、例えばスファエロセカ属 (*Sphaerotheca*) 種に対して使用すると、特に良好な結果が得られる。

10

【0074】

本発明の活性化合物は、作物の収穫を増やすことにも適する。加えて、これらは、低減された毒性を示し、且つ、植物に充分許容される。

【0075】

適切な場合には、本発明の活性化合物は、一定の濃度および塗布率で、植物成長を調節するため、および動物有害生物を防除するための除草剤、農薬としても使用される。適切な場合には、それらは、他の活性化合物の合成における中間体または前駆体としても使用される。

【0076】

本発明によれば、すべての植物および植物の部分を処理することができる。植物は、望ましいおよび望ましくない野生植物または農作物植物 (天然農作物植物を含む) などのすべての植物および植物群をここでは意味するもののご理解いただきたい。農作物植物は、従来の繁殖法および至適化法によって、または生物工学的な方法および遺伝子工学法またはこれらの方法の併用によって得ることができる植物であり、トランスジェニック植物を含むとともに、植物育種家の証明によって保護可能もしくは保護可能でない植物栽培品種を含む。植物部分は、苗条、葉、花および根などの植物の地上および地下のすべての部分および器官を意味するもののご理解いただきたい。その例には、葉、針、茎、幹、花、子実体、果実および種子、ならびにまた、根、塊茎および根茎を挙げることができる。植物の部分には、収穫物、ならびに栄養繁殖材料および生殖繁殖材料、例えば、実生、塊茎、根茎、挿し木および種子も含まれる。

20

30

【0077】

既に上で述べたように、本発明に従ってすべての植物および植物の部分を処理することが可能である。好ましい実施形態では、野生植物種および植物栽培品種、または交配またはプロトプラスト融合などの通常の生物学的繁殖法によって得られるもの、およびそれらの部分が処理される。さらに好ましい実施形態では、適する場合には通常法との併用で、遺伝子工学によって得られるトランスジェニック植物および植物栽培品種 (*Genetically Modified Organisms*) ならびにそれらの部分が処理される。用語「部分」、「植物の部分」または「植物部分」は、上で説明した。

【0078】

特に好ましくは、前記植物栽培品種の植物 (それぞれの場合、市販されているまたは使用されている) は、本発明に従って処理される。植物栽培品種は、新しい特性 (「形質」) を有する、また、通常の繁殖によって、突然変異によって、または組換えDNA法によって得られた植物を意味するもののご理解いただきたい。それらは、栽培品種、変種、バイオタイプおよびゲノタイプであることができる。

40

【0079】

植物種または植物栽培品種、それらの所在地および成長条件 (土壌、天候、生育期、食物) によっては、本発明の処理によって超加成 (「相乗」) 作用が生じることもある。従って、実際に予想した効果を超える、例えば、本発明に従って使用することができる物質および組成物の塗布率低減および/または活性領域の拡大および/または活性の増大、良

50

好な植物成長、高温または低温に対する耐性増強、旱魃に対するまたは水もしくは土壌の塩分に対する耐性増強、開花機能向上、より容易な収穫、成熟促進、より高い収穫量、収穫物のより良好な品質および/またはより高い栄養価、収穫物のより良好な貯蔵安定性および/または加工性が可能である。

【0080】

好ましい、また、本発明に従って処理することができるトランスジェニック植物または植物栽培変種(すなわち、遺伝子工学によって得られたもの)は、遺伝学的修飾においてこれらの植物に特に有利で有用な特性(「形質」)が付与された遺伝物質を受け取ったすべての植物を包含する。こうした特性の例は、より良好な植物成長、高温または低温に対する耐性増強、旱魃に対するまたは水もしくは土壌の塩分に対する耐性増強、開花機能向上、より容易な収穫、成熟促進、より高い収穫率、収穫物のより良好な品質および/またはより高い栄養価、収穫物のより良好な貯蔵安定性および/または加工性である。こうした特性のさらに、また特に重要視される例は、昆虫、ダニ類、植物寄生病原性真菌、細菌および/またはウイルスなどの動物有害生物および有害微生物に対するさらに良好な植物防御であり、ならびに一定の除草活性化合物に対する植物の耐性増強でもある。トランスジェニック植物の例には、穀類(小麦、米)、トウモロコシ、大豆、ジャガイモ、綿、ナタネなどの重要な農作物植物、およびまた果実植物(果実リンゴ、ナシ、柑橘類およびブドウを伴う)を挙げることができ、トウモロコシ、大豆、ジャガイモ、綿およびナタネは、特に重要視される。植物において生成される毒による、特に、バシラス・スリンジエンシス(*Bacillus thuringiensis*)からの遺伝物質によって(例えば、遺伝子CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3BbおよびCryIFならびにそれらの組み合わせによって)植物において生成される毒による、昆虫に対する植物の防御増強は、特に重要視される形質である(以後、「Bt植物」と呼ぶ)。全身性獲得耐性(SAR)、システミン、フィトアレキシウス、誘発遺伝子および耐性遺伝子、ならびに対応して発現される蛋白質および毒素による、真菌、細菌およびウイルスに対する植物の防御増強も特に重要視される形質である。一定の除草活性化合物、例えば、イミダゾリノン、スルホニル尿素、グリホサートまたはホスフィノトリシン(例えば、「PAT」遺伝子)に対する植物の耐性増強は、さらに特に重要視される形質である。望ましい形質を付与する前記遺伝子は、トランスジェニック植物中に互いに組み合わせられた状態で存在することもありうる。「Bt植物」の例には、商品名YIELD GARD(登録商標)(例えば、トウモロコシ、綿、大豆)、KnockOut(登録商標)(例えば、トウモロコシ)、SatrLink(登録商標)(例えば、トウモロコシ)、Bollgard(登録商標)(綿)、Nucoton(登録商標)(綿)およびNewLeaf(登録商標)(ジャガイモ)で販売されているトウモロコシ変種、綿変種、大豆変種およびジャガイモ変種を挙げることができる。除草薬耐性植物の例には、商品名Roundup Ready(登録商標)(グリホサートに対する耐性、例えば、トウモロコシ、綿、大豆)、Liberty Link(登録商標)(ホスフィノトリシンに対する耐性、例えば、ナタネ)、IMI(登録商標)(イミダゾリノンに対する耐性)およびSTS(登録商標)(スルホニル尿素に対する耐性、例えば、トウモロコシ)で販売されているトウモロコシ変種、綿変種および大豆変種を挙げることができる。除草薬耐性植物(除草薬耐性のための通常の方法で繁殖させた植物)には、商品名Clearfield(登録商標)(例えば、トウモロコシ)で販売されている変種を挙げることができる。勿論、これらの言明は、これらの遺伝形質を有する植物栽培品種、または将来開発されるおよび/または市販される、さらに開発された遺伝形質を有する植物栽培変種にも適用される。

【0081】

列挙した植物は、本発明によれば、特に有利な方法で、本発明の一般式(I)の化合物または本活性化合物の混合物で、処理することができる。本活性化合物または混合物に関する上述の好ましい範囲は、これらの植物の処理にもあてはまる。

【0082】

10

20

30

40

50

本明細書中で特に言及する化合物または混合物での植物の処理は、特に重要視される。

【0083】

本活性化化合物での植物および植物の部分の本発明による処理は、直接行うことができ、または慣用の処理法に従って、例えば、浸漬、吹付け、蒸発、噴霧、散布、塗布により、および繁殖材料の場合、特に、種子の場合には、さらに一層または多層コーティングを施すことにより、本化合物の組合せをそれらの環境、生息場所または貯蔵空間に対して作用させることによって行うことができる。

【0084】

材料の保護において、本発明の化合物は、望ましくない微生物による感染および破壊から工業材料を保護するために使用することができる。

10

【0085】

本文脈における工業材料は、工業において使用するために準備された非生体材料を意味すると理解される。例えば、本発明の活性化化合物によって微生物による変化または破壊から保護されると思われる工業材料は、粘着付与剤、サイズ剤、紙および厚紙、織物、革、木材、塗料およびプラスチック製品、冷却潤滑剤、ならびに微生物によって感染または破壊される他の材料でありうる。微生物の増殖により傷害が発生しうる生産プラントの一部、例えば、水冷回路も、保護すべき材料の範囲内で挙げるることができる。本発明の範囲内で挙げるることができる工業材料は、好ましくは、粘着付与剤、サイズ剤、紙および厚紙、革、木材、塗料、冷却潤滑剤および熱交換液であり、特に好ましくは、木材である。

【0086】

工業材料を劣化または変化させることができる微生物には、例えば、細菌、真菌、酵母菌、藻類および粘液生物を挙げるることができる。本発明の活性化化合物は、好ましくは、真菌、特にカビ、木材変色性および木材破壊性真菌（担子菌類（Basidiomycetes））に対して、ならびに粘液生物および藻類に対して作用する。

20

【0087】

例として、以下の属の微生物を挙げるることができる。

【0088】

アルテルナリア属（*Alternaria*）：アルテルナリア・テナス（*Alternaria tenuis*）など。

【0089】

コウジカビ属（*Aspergillus*）：黒色コウジ菌（*Aspergillus niger*）など。

30

【0090】

ケトミウム属（*Chaetomium*）：ケトミウム・グラボーサム（*Chaetomium globosum*）など。

【0091】

カニオフォラ属（*Coniophora*）：イドタケ（*Coniophora puteana*）など。

【0092】

マツオウジ属（*Lentinus*）：ケガワタケ（*Lentinus tigrinus*）など。

40

【0093】

ペニシリウム属（*Penicillium*）：アオカビ（*Penicillium glaucum*）など。

【0094】

タマチョレイタケ属（*Polyporus*）：ポリポラス・バージカラー（*Polyporus versicolor*）など。

【0095】

アウレオバシジウム属（*Aureobasidium*）：黒酵母（*Aureobasidium pullulans*）など。

50

## 【0096】

スクレロフォーマ属 (Sclerophoma) : スクレロフォーマ・ピティオフィラ (Sclerophoma pityophila) など。

## 【0097】

トリコデルマ属 (Trichoderma) : トリコデルマ・ビリディ (Trichoderma viride) など。

## 【0098】

エシュリキア属 (Escherichia) : 大腸菌 (Escherichia coli) など。

## 【0099】

シュードモナス属 (Pseudomonas) : 緑膿菌 (Pseudomonas aeruginosa) など。

## 【0100】

ブドウ球菌属 (Staphylococcus) : 黄色ブドウ球菌 (Staphylococcus aureus) など。

## 【0101】

個々の物理的および/または化学的性質に依存して、本活性化合物の組合せは、溶液、エマルジョン、懸濁液、粉末、フォーム、ペースト、顆粒、エーロゾルならびに高分子物質中および種子用コーティング組成物中にマイクロカプセル化したものなどの慣用の調合物、ならびにULV冷および温煙霧用調合物に加工することができる。

## 【0102】

これらの調合物は、既知の方法で、例えば、界面活性剤、すなわち乳化剤および/もしくは分散剤、ならびに/または発泡剤を場合によっては使用して、本活性化合物を増量剤、すなわち液体溶媒、加圧下の液化ガス、および/または固体担体と混合物することにより製造される。使用される増量剤が水である場合、例えば有機溶媒を補助溶媒として使用することも可能である。本質的に、適する液体溶媒は、芳香族化合物(キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレンなど)、塩素化芳香族化合物または塩素化脂肪族炭化水素(クロロベンゼン、クロロエチレンまたは塩化メチレンなど)、脂肪族炭化水素(シクロヘキサンまたはパラフィン、例えば、石油留分など)、アルコール(ブタノールまたはグリコールなど)ならびにそれらのエーテルおよびエステル、ケトン(アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサノンなど)、強極性溶媒(ジメチルホルムアミドおよびジメチルスルホキシドなど)であり、でなければ水である。液化ガスの増量剤または担体は、標準温度および大気圧下で気体状である液体、例えば、ハロゲン化炭化水素などのエーロゾル噴射剤、でなければブタン、プロパン、窒素および二酸化炭素を意味するとご理解いただきたい。適する固体担体は、例えば、粉碎天然鉱物(カオリン、クレー、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイトまたは珪藻土など)および粉碎合成鉱物(高分散シリカ、アルミナおよびシリケートなど)である。顆粒用の適する固体担体は、例えば、破碎し、分別した天然石(方解石、大理石、軽石、海泡石およびドロマイトなど)であり、でなければ無機および有機ミールの合成顆粒、ならびに有機材料(おがくず、ヤシ殻、トウモロコシの穂軸およびタバコの茎など)の顆粒である。適する乳化剤および/または発泡剤は、例えば、非イオン性およびアニオン性乳化剤(ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル、例えば、アルキルアリアルポリグリコールエーテル、アルキルスルホネート、アルキルスルフェート、アリアルスルホネートなど)であり、でなければ蛋白水解物である。適する分散剤は、例えば、リグノ亜硫酸排液およびメチルセルロースである。

## 【0103】

カルボキシメチルセルロース、ならびに粉末、顆粒またはラテックスの形態の天然および合成ポリマー(アラビアゴム、ポリビニルアルコールおよびポリ酢酸ビニルなど)、でなければ天然リン脂質(セファリンおよびレシチンなど)および合成リン脂質のような粘着付与剤を本調合物に使用することができる。他の可能な添加剤には、鉱物油および植物

10

20

30

40

50

油がある。

【0104】

無機顔料（例えば、酸化鉄、酸化チタンおよびプルシアンブルー）、および有機染料（アリザリン染料、アゾ染料および金属種フタロシアニン染料など）、および微量栄養素（鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩など）などの着色剤の使用が可能である。

【0105】

本調合物は、活性化合物を一般には0.1重量%と95重量%の間、好ましくは0.5重量%と90重量%の間含む。

【0106】

本発明の活性化合物は、そのままか、またはそれらの調合物の形態で使用することができ、例えば、有効な範囲を広げるために、もしくは耐性の発生を防ぐために、既知殺真菌薬、殺菌薬、ダニ駆除薬、殺線虫薬または殺虫剤との混合物で使用することもできる。多くの場合、相乗効果が得られ、すなわち、混合物の活性は、個々の成分の活性より大きい。

【0107】

適する混合成分は、例えば以下の化合物である。

【0108】

殺真菌薬：

アルジモルフ、アムプロピルホス、アムプロピルホス - カリウム、アンドプリム、アニラジン、アザコナゾール、アゾキシストロビン、

ベナラキシル、ベノダニル、ベノミル、ベンザマクリル、ベンザマクリル - イソブチル、ピアラホス、ピナパクリル、ピフェニル、ピタータノール、プラスチックジン - S、プロムコナゾール、ピリメート、ブチオベート、

多硫化カルシウム、カプロパミド、カプシマイシン、ダイホルタン (captafol)、カプタン、カルベンダジム、カルボキシシン、カルボン、キノメチオネート (chinomethinat (quinomethionat))、クロベンチアゾン、クロルフエナゾール、クロロネブ、クロロピクリン、クロロサロニル、クロゾリネート、クロジラコム、クフラネブ、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロジニル、シプロフラム、

デバカルブ、ジクロロフェン、ジクロブトラゾール、ジクロフルアニド、ジクロメジン、ジクロラン、ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジメチリモール、ジメトモルフ、ジニコナゾール、ジニコナゾール - M、ジノキャップ、ジフェニルアミン、ジピリチオン、ジタリムホス、ジチアノン、ドデモルフ、ドジン、ドラゾキシロン、

エジフェンホス、エポキシコナゾール、エタコナゾール、エチリモール、エトリジアゾール、

ファモキサドン、フェナパニル、フェナリモール、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェンヘキサミド、フェニトロパン、フェンピクロニル、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、フェンチン - アセテート、フェンチン - ヒドロキシド、フェルバム、フェリムゾン、フルアジナム、フルメトバー、フルオロマイド、フルキンコナゾール、フルルブリミドール、フルシラゾール、フルスルファミド、フルトラニル、フルトリアホール、ホルペット、ホセチル - アルミニウム、ホセチル - ナトリウム、フサライド、フベリダゾール、フララキシル、フラメトピル、フルカルボニル、フルコナゾール、フルコナゾール - cis、フルメシクロクス、

グアザチン、

ヘキサクロロベンゼン、ヘキサコナゾール、ヒメキサゾール、

イマザリル、イミベンコナゾール、イミノオクタジン、イミノオクタジンアルベシレート、イミノクタジントリアセテート、ヨードカルブ、イブコナゾール、イプロベンホス (IBP)、イプロジオン、イプロバリカルブ、イルマイシン、イソプロチオラン、イソバレジオン、

カスガマイシン、クレソキシム - メチル、銅調製物（水酸化銅、ナフテン酸銅、オキシ

10

20

30

40

50

塩化銅、硫酸銅、酸化銅、オキシ銅およびボルドー合剤など)、

マンコッパー、マンコゼブ (mancozeb)、マネブ、メフェリムゾン、メパニピリム、メプロニル、メタラキシル、メトコナゾール、メタスルホカルブ、メトフロキサム、メチラム、メトメクラム、メトスルホバクス、ミルジオマイシン、マイクロブタニル、マイクロゾリン、

ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、ニトロサール - イソプロピル、ヌアリモール、オフラス、オキサジキシル、オキサモカルブ、オキソリン酸、オキシカルボキシム、オキシフェンチン、

バクロブトラゾール、ペフラゾエート、ペンコナゾール、ペンシクロン、ホスジフェン、ピコキシストロピン、ピマリシン、ピペラリン、ポリオキシソリム、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパモカルブ、プロパノシン - ナトリウム、プロピコナゾール、プロピネブ、ピラクロストロピン、ピラゾホス、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピロキロン、ピロキシフル、

キンコナゾール、キントゼン (PCNB)、キノキシフェン、

硫黄および硫黄調製物、スピロオキサミン、

テブコナゾール、テクロフタラム、テクナゼン、テトシクラシス、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チシオフェン、チフルザミド、チオファネート - メチル、チラム、チオキシミド、トルクロホス - メチル、トリルフルアニド、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアズブチル、トリアゾキシド、トリクラミド、トリシクラゾール、トリデモルフ、トリフロキシストロピン、トリフルミゾール、トリホリン、トリチコナゾール、

ユニコナゾール、

バリダマイシン A、ピンクロゾリン、ピンコナゾール、

ザリルアミド、ジネブ、ジラム、ならびにまた

Dagger G、

OK 8705、

OK 8801、

- (1, 1 - ジメチルエチル) - - (2 - フェノキシエチル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - エタノール、

- (2, 4 - ジクロロフェニル) - - フルオロ - - プロピル - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - エタノール、

- (2, 4 - ジクロロフェニル) - - メトキシ - - メチル - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - エタノール、

(5 - メチル - 1, 3 - ジオキサソ - 5 - イル) - - [[4 - (トリフルオロメチル) - フェニル] - メチレン] 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - エタノール、

(5RS, 6RS) - 6 - ヒドロキシ - 2, 2, 7, 7 - テトラメチル - 5 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) - 3 - オクタノン、

(E) - - (メトキシイミノ) - N - メチル - 2 - フェノキシ - フェニルアセトアミド、

1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) - エタノン - O - (フェニルメチル) - オキシム、

1 - (2 - メチル - 1 - ナフタレニル) - 1H - ピロール - 2, 5 - ジオン、

1 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 3 - (2 - プロペニル) - 2, 5 - ピロリジンジオン、

1 - [(ジヨードメチル) - スルホニル] - 4 - メチル - ベンゼン、

1 - [[2 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル] - メチル - 1H - イミダゾール、

1 - [[2 - (4 - クロロフェニル) - 3 - フェニルオキシラニル] - メチル] - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、

1 - [1 - [2 - [(2, 4 - ジクロロフェニル) - メトキシ] - フェニル] - エテニル] - 1H - イミダゾール、

10

20

30

40

50

- 1 - メチル - 5 - ノニル - 2 - (フェニルメチル) - 3 - ピロリジノール、  
 2', 6' - ジブromo - 2 - メチル - 4' - トリフルオロメトキシ - 4' - トリフルオ  
 ロ - メチル - 1, 3 - チアゾール - 5 - カルボキサニリド、  
 2, 6 - ジクロロ - 5 - (メチルチオ) - 4 - ピリミジニル - チオシアネート、  
 2, 6 - ジクロロ - N - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - ベンズアミド、  
 2, 6 - ジクロロ - N - [ [ 4 - (トリフルオロメチル) - フェニル ] - メチル ] - ベ  
 ンズアミド、  
 2 - (2, 3, 3 - トリヨード - 2 - プロベニル) - 2H - テトラゾール、  
 2 - [ (1 - メチルエチル) - スルホニル ] - 5 - (トリクロロメチル) - 1, 3, 4  
 - チアジアゾール、  
 2 - [ [ 6 - デオキシ - 4 - O - (4 - O - メチル - D - グリコピラノシル) -  
 - D - グリコピラノシル ] - アミノ ] - 4 - メトキシ - 1H - ピロロ [ 2, 3 - d ] ピリ  
 ミジン - 5 - カルボニトリル、  
 2 - アミノブタン、  
 2 - プロモ - 2 - (プロモメチル) - ペンタンジニトリル、  
 2 - クロロ - N - (2, 3 - ジヒドロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 1H - インデン - 4  
 - イル) - ピリジンカルボキサミド、  
 2 - クロロ - N - (2, 6 - ジメチルフェニル) - N - (イソチオシアナトメチル) -  
 アセトアミド、  
 2 - フェニルフェノール (OPP)、  
 3, 4 - ジクロロ - 1 - [ 4 - (ジフルオロメトキシ) - フェニル ] - 1H - ピロール  
 - 2, 5 - ジオン、  
 3, 5 - ジクロロ - N - [ シアノ (1 - メチル - 2 - プロピニル) - オキシ ] - メチル  
 ] - ベンズアミド、  
 3 - (1, 1 - ジメチルプロピル - 1 - オキソ - 1H - インデン - 2 - カルボニトリル  
 、  
 3 - [ 2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - エトキシ - 3 - イソキサゾリジニル ] - ピリ  
 ジン、  
 4 - クロロ - 2 - シアノ - N, N - ジメチル - 5 - (4 - メチルフェニル) - 1H - イ  
 ミダゾール - 1 - スルホンアミド、  
 4 - メチル - テトラゾロ [ 1, 5 - a ] キナゾキリン - 5 (4H) - オン、  
 硫酸 8 - ヒドロキシキノリン、  
 9H - キサンテン - 2 - [ (フェニルアミノ) - カルボニル ] - 9 - カルボン酸ヒドラ  
 ジド、  
 ビス - (1 - メチルエチル) - 3 - メチル - 4 - [ (3 - メチルベンゾイル) - オキシ  
 ] - 2, 5 - チオフェンジカルボキシレート、  
 cis - 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、  
 塩酸 cis - 4 - [ 3 - [ 4 - (1, 1 - ジメチルプロピル) - フェニル - 2 - メチル  
 プロピル ] - 2, 6 - ジメチル - モルホリン、  
 [ (4 - クロロフェニル) - アゾ ] - シアノ酢酸エチル、  
 重炭酸カリウム、  
 メタンテトラチオール・ナトリウム塩、  
 1 - (2, 3 - ジヒドロ - 2, 2 - ジメチル - 1H - インデン - 1 - イル) - 1H - イ  
 ミダゾール - 5 - カルボン酸メチル、  
 N - (2, 6 - ジメチルフェニル) - N - (5 - イソキサゾリルカルボニル) - DL -  
 アラニン酸メチル、  
 N - (クロロアセチル) - N - (2, 6 - ジメチルフェニル) - DL - アラニン酸メチ  
 ル、  
 N - (2, 6 - ジメチルフェニル) - 2 - メトキシ - N - (テトラヒドロ - 2 - オキソ

10

20

30

40

50



- 3 - フラニル) - アセトアミド、  
 N - ( 2 , 6 - ジメチルフェニル ) - 2 - メトキシ - N - ( テトラヒドロ - 2 - オキソ  
 - 3 - チェニル ) - アセトアミド、  
 N - ( 2 - クロロ - 4 - ニトロフェニル ) - 4 - メチル - 3 - ニトロ - ベンゼンスルホ  
 ンアミド、  
 N - ( 4 - シクロヘキシルフェニル ) - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - 2 - ピリミジ  
 ンアミン、  
 N - ( 4 - ヘキシルフェニル ) - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - 2 - ピリミジンアミ  
 ン、  
 N - ( 5 - クロロ - 2 - メチルフェニル ) - 2 - メトキシ - N - ( 2 - オキソ - 3 - オ  
 キサゾリジニル ) - アセトアミド、  
 N - ( 6 - メトキシ - 3 - ピリジニル ) - シクロプロパンカルボキサミド、  
 N - [ 2 , 2 , 2 - トリクロロ - 1 - [ ( クロロアセチル ) - アミノ ] - エチル ] - ベ  
 ンズアミド、  
 N - [ 3 - クロロ - 4 , 5 - ビス - ( 2 - プロピニルオキシ ) - フェニル ] - N ' - メ  
 トキシ - メタンイミドアミド、  
 N - ホルミル - N - ヒドロキシ - D L - アラニン - ナトリウム塩、  
 [ 2 - ( ジプロピルアミノ ) - 2 - オキソエチル ] - エチルホスホロアミドチオ酸 O ,  
 O - ジエチル、  
 フェニルプロピルホスホロアミドチオ酸 O - メチル S - フェニル、  
 1 , 2 , 3 - ベンゾチアジアゾール - 7 - カルボチオ酸 S - メチル、  
 スピロ [ 2 H ] - 1 - ベンゾピラン - 2 , 1 ' ( 3 ' H ) - イソベンゾフラン ] - 3 '  
 - オン、  
 4 - [ ( 3 , 4 - ジメトキシフェニル ) - 3 - ( 4 - フルオロフェニル ) - アクリロイ  
 ル ] - モルホリン。

## 【 0 1 0 9 】

## 殺菌薬：

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、プロペ  
 ナゾール、ストレプトマイシン、テクロフタラム、硫酸銅および他の銅調製物。

## 【 0 1 1 0 】

## 殺虫剤 / ダニ駆除薬 / 殺線虫薬：

アバメクチン、アセフェート、アセトアミプリド、アクリナトリン、アラニカルブ、ア  
 ルジカルブ、アルドキシカルブ、アルファシベルメトリン、アルファメトリン、アミトラ  
 ズ、アベルメクチン、A Z - 6 0 5 4 1、アザジラクチン、アザメチホス、アジンホス A  
 、アジンホス M、アゾシクロチン、  
 乳化病菌 ( *Bacillus popilliae* )、バシラス・スフェリカス ( *Ba  
 cillus sphaericus* )、枯草菌 ( *Bacillus subtilis* )、バシラス・スリンジエンシス ( *Bacillus thuringiensis* )、  
 バキュロウイルス、ポーバリア・パッシアーナ ( *Beauvaria bassiana* )、  
 ポーバリア・テネーラ ( *Beauvaria tenella* )、ベンジオカルブ、  
 ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ベンゾキシメート、ベータシフルトリン、ピフェナゼ  
 ート、ピフェントリン、バイオエタノメトリン、バイオパーメトリン、ビストリフルロン  
 、B P M C、プロモホス A、プフェンカルブ、ププロフェジン、プタチオホス、プトカル  
 ボキシム、プチルピリダベン、

カズサホス、カルパリル、カルボフラン、カルボフェノチオン、カルボスルファン、カ  
 ルタップ、クロエトカルブ、クロルエトキシホス、クロルフェナピル、クロルフェンピン  
 ホス、クロルフルアズロン、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホス M、クロバ  
 ポルトリン、クロマフェノジド、cis - レスメトリン、cis - パーメトリン、クロシ  
 トリン、クロエトカルブ、クロフェンテジン、クロチアニジン、シアノホス、シクロプレ

ン、シクロプロトリン、シフルトリン、シハロトリン、シヘキサチン、シパーメトリン、シロマジン、

デルタメトリン、デメトンM、デメトンS、デメトン-S-メチル、ジアフェンチウロン、ジアジノン、ジクロルボス、ジコホル、ジフルベンズウロン、ジメトエート、ジメチルビンホス、ジオフェノラン、ジスルホトン、ドクサット-ナトリウム、ドフェナピン、エフルシラネート、エマメクチン、エムベントリン、エンドスルファン、ハエカビ属種 (Entomophthora spp.)、エスフェンバレレート、エチオフェンカルブ、エチオン、エトプロホス、エトフェンプロックス、エトキサゾール、エトリムホス、フェナミホス、フェナザキン、フェンブタチンオキシド、フェニトロチオン、フェノチオカルブ、フェノキサクリム、フェノキシカルブ、フェンプロパトリン、フェンピラド、フェンピリトリン、フェンピロキシメート、フェンバレレート、フィプロニル、フルアズロン、フルプロシトリネート、フルシクロキュロン、フルシトリネート、フルフェノキュロン、フルメトリン、フルテンジン、フルバリネート、ホノホス、ホスメチラン、ホスチアゼート、フブフェンプロックス、フラチオカルブ、

10

顆粒症ウイルス、

ハロフェノジド、HCH、ヘプテノホス、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾクス、ヒドロブレン、

イミダクロピリド、インドキサカルブ、イサゾホス、イソフェンホス、イソオキサチオン、イベルメクチン、

20

核多角体病ウイルス、

ラムダ-シハロトリン、ルフェヌロン、

マラチオン、メカルバム、メタアルデヒド、メタアミドホス、メサルヒジウム・アニソプリエ (Metharhizium anisopliae)、メサルヒジウム・フラボピリデ (Metharhizium flavoviride)、メチダチオン、メチオカルブ、メトブレン、メトミル、メトキシフェノジド、メトルカルブ、メトキサジアゾン、メビンホス、ミルベメクチン、ミルベマイシン、モノクロトホス、

ナレド、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、

オメトエート、オキサミル、オキシデメトンM、

ペシロマイセス・フモソルセウス (Paecilomyces fumosoroseus)、パラチオンA、パラチオンM、パーメトリン、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメト、ホスファミドン、ホキシム、ピリミカルブ、ピリミホスA、ピリミホスM、プロフェノホス、プロメカルブ、プロパルギット、プロポスキル、プロチオホス、プロトエート、ピメトロジン、ピラクロホス、ピレスメトリン、ジョチュウギク、ピリダベン、ピリダチオン、ピリミジフェン、ピリプロキシフェン、

30

キナルホス、

リバピリン、

サリチオン、セブホス、シラフルオフエン、スピノサド、スピロジクロフェン、スルホテブ、スルプロホス、

タウ-フルバリネート、テブフェノジド、テブフェンピラド、テブピリミホス、テフルベンズロン、テフルトリン、テメホス、テミピンホス、ターブホス、テトラクロルピンホス、テトラジホン、シータ-シベルメトリン、チアクロピリド、チアメトキサム、チアプロニル、チアトリホス、シュウ酸水素チオシクラム、チオジカルブ、チオフアノックス、サーリンジエシン、トラロシトリン、トラロメトリン、トリアラテン、トリアザメート、トリアゾホス、トリアズロン、トリクロフェニジン、トリクロルホン、トリフルムロン、トリメタカルブ、

40

バミドチオン、バニリプロール、バーティシリウム・レカニイ (Verticillium lecanii)、

YI5302、

ゼータ-シベルメトリン、ゾラプロホス、

3-「(ジヒドロ-2-オキソ-3(2H)-フラニリデン)-メチル]-2,2-ジ

50

メチルシクロプロパンカルボン酸 ( 1 R - c i s ) - [ 5 - ( フェニルメチル ) - 3 - フ  
ラニル ] - メチル、  
2 , 2 , 3 , 3 - テトラメチルシクロプロパンカルボン酸 ( 3 - フェノキシフェニル )  
- メチル、  
1 - [ ( 2 - クロロ - 5 - チアゾリル ) メチル ] テトラヒドロ - 3 , 5 - ジメチル - N  
- ニトロ - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 ( 1 H ) - イミン、  
2 - ( 2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル ) - 4 - [ 4 ( 1 , 1 - ジメチルエチル )  
フェニル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - オキサゾール、  
2 - ( アセチルオキシ ) - 3 - ドデシル - 1 , 4 - ナフタレンジオン、  
2 - クロロ - N - [ [ [ 4 - ( 1 - フェニルエトキシ ) - フェニル ] - アミノ ] - カル  
ボニル ] - ベンズアミド、  
2 - クロロ - N - [ [ [ 4 - ( 2 , 2 - ジクロロ - 1 , 1 - ジフルオロエトキシ ) - フ  
ェニル ] - アミノ ] - カルボニル ] - ベンズアミド、  
プロピルカルバミン酸 3 - メチルフェニル、  
4 - [ 4 - ( 4 - エトキシフェニル ) - 4 - メチルフェニル ] 1 - フルオロ - 2 - フ  
ェノキシ - ベンゼン、  
4 - クロロ - 2 - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) - 5 - [ [ 2 - ( 2 , 6 - ジメチル - 4  
- フェノキシフェノキシ ) エチル ] チオ ] - 3 ( 2 H ) - ピリダジノン、  
4 - クロロ - 2 - ( 2 - クロロ - 2 - メチルプロピル ) - 5 - [ ( 6 - ヨード - 3 - ピ  
リジニル ) メトキシ ] - 3 ( 2 H ) - ピリダジノン、  
4 - クロロ - 5 - [ ( 6 - クロロ - 3 - ピリジニル ) メトキシ ] - 2 - ( 3 , 4 - ジク  
ロロフェニル ) - 3 ( 2 H ) - ピリダジノン、  
バチルス - スリンジエンシス ( *Bacillus thuringiensis* ) E G  
- 2 3 4 8 株、  
2 - ベンゾイル - 1 - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) - ヒドラジノ安息香酸、  
酪酸 2 , 2 - ジメチル - 3 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - オキソ - 1 - オキサ  
スピロ [ 4 . 5 ] デク - 3 - エン - 4 - イル  
[ 3 - [ ( 6 - クロロ - 3 - ピリジニル ) メチル ] - 2 - チアゾリジニリデン ] - シア  
ナミド、  
ジヒドロ - 2 - ( ニトロメチレン ) - 2 H - 1 , 3 - チアジン - 3 ( 4 H ) - カルボキ  
シアルデヒド、  
[ 2 - [ [ 1 , 6 - ジヒドロ - 6 - オキソ - 1 - ( フェニルメチル ) - 4 - ピリダジニ  
ル ] オキシ ] エチル ] カルバミン酸エチル、  
N - ( 3 , 4 , 4 - トリフルオロ - 1 - オキソ - 3 - ブテニル ) - グリシン、  
N - ( 4 - クロロフェニル ) - 3 - [ 4 - ( ジフルオロメトキシ ) フェニル ] - 4 , 5  
- ジヒドロ - 4 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - カルボキサミド、  
N - [ ( 2 - クロロ - 5 - チアゾリル ) メチル ] - N ' - メチル - N " - ニトロ - グア  
ニジン、  
N - メチル - N ' - ( 1 - メチル - 2 - プロベニル ) - 1 , 2 - ヒドラジンジカルボチ  
オアミド、  
N - メチル - N ' - 2 - プロベニル - 1 , 2 - ヒドラジンジカルボチオアミド、  
[ 2 - ( ジプロピルアミノ ) - 2 - オキソエチル ] - エチルホスホルアミドチオ酸 O ,  
O - ジエチル、  
N - シアノメチル - 4 - トリフルオロメチル - ニコチンアミド、  
3 , 5 - ジクロロ - 1 - ( 3 , 3 - ジクロロ - 2 - プロベニルオキシ ) - 4 - [ 3 - ( 5  
- トリフルオロメチルピリジン - 2 - イルオキシ ) - プロポキシ ] - ベンゼン。  
【 0 1 1 1 】  
除草剤などの他の既知活性化合物との混合、または肥料および成長調節剤との混合も可  
能である。  
【 0 1 1 2 】

加えて、本発明の式(I)の化合物は、非常に良好な抗真菌活性も有する。これらは、特に、皮膚糸状菌および酵母菌、カビおよび二相性真菌(例えば、カンジダ・アルビカンス(*Candida albicans*)、カンジダ・グラブラタ(*Candida glabrata*)などのカンジダ属(*Candida*)種)、および有毛表皮糸状菌(*Epidermophyton floccosum*)、コウジカビ属(*Aspergillus*)種[黒色コウジ菌(*Aspergillus niger*)およびアスペルギルス・フミガーツス(*Aspergillus fumigatus*)など]、白癬菌属(*Trichophyton*)種[毛瘡白癬菌(*Trichophyton mentagrophytes*)など]、小孢子菌属(*Microsporum*)種[イヌ小孢子菌(*Microsporum canis*)およびオードアン小孢子菌(*Microsporum audouinii*)など]に対して、非常に広い抗真菌活性範囲を有する。これらのリストは、包含することができる真菌範囲を限定するものでは決してなく、単なる実例である。

10

## 【0113】

本活性化合物は、そのまま使用すること、それらの調合物の形態で使用すること、またはそれらから調製された使用形態(すぐに使用できる溶液、懸濁液、水和剤、ペースト、可溶性粉末、微粉および顆粒など)で使用することができる。塗布は、慣用の方法で、例えば、液剤散布、吹付け、噴霧、散布、散粉、発泡、展着などによって行われる。超低量法により本活性化合物を塗布すること、または本活性化合物の調製物または本活性化合物それ自体を土壌に注入することが、さらに可能である。植物の種子を処理することも可能である。

20

## 【0114】

本発明の活性化合物を殺真菌薬として使用する時、その塗布率は、塗布の種類に依存して比較的広い範囲で変化させることができる。植物の部分処理するための本活性化合物の塗布率は、一般には0.1g/haと10,000g/haの間、好ましくは10g/haと1000g/haの間である。種子のドレッシングのための本活性化合物の塗布率は、一般には種子1kgに対して0.001gと50gの間、好ましくは種子1kgに対して0.01gと10gの間である。土壌の処理のための本活性化合物の塗布率は、一般には0.1g/haと10,000g/haの間、好ましくは1g/haと5000g/haの間である。

30

## 【0115】

本発明の化合物の調製および使用を下の実施例によって説明する。しかし、本発明は、それらの実施例に限定されない。

## 【発明を実施するための最良の形態】

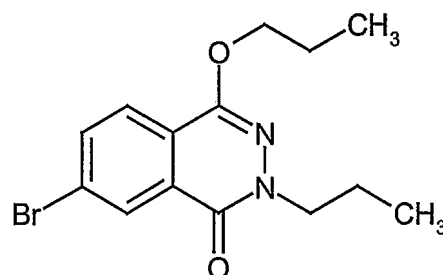
## 【0116】

調製例

(実施例1)

## 【0117】

## 【化14】



40

## 【0118】

方法a)

10 およびアルゴン下で、12.8g(0.23mol)の粉末水酸化カリウムを、

50

ジメチルスルホキシド (500 mL) 中の 25 g (0.1 mol) の 6 - ブロモ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - フタラジンジオンの溶液に添加する。その後、この温度で、19.3 g (0.23 mol) のヨードプロパンを一滴ずつ添加し、その後、さらに冷却せずに室温で一晩その混合物を攪拌する。その反応混合物を 2.5 L の水に注入し、各場合 400 mL の酢酸エチルで 3 回抽出する。併せた有機相を各場合 400 mL の水で 2 回洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮する。残留物を、石油エーテル / メチル t - ブチルエーテル (最初は 40 : 1、最終的に 20 : 1 の比率) を使用するシリカゲルでのクロマトグラフィーに付す。これによって、14.2 g (理論値の 42.1%) の 7 - ブロモ - 4 - プロポキシ - 2 - プロピル - 1 (2H) - フタラジノンが得られる。

【0119】

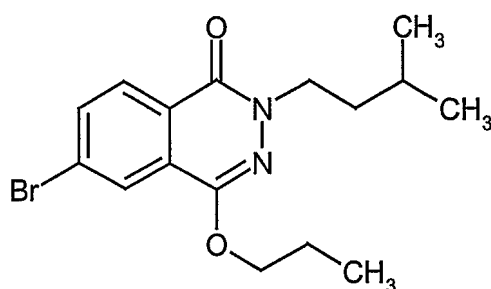
HPLC : log P = 4.76。

【0120】

(実施例 2)

【0121】

【化15】



【0122】

方法 b)

0.14 g (1.12 mmol) の粉末水酸化カリウムを、ジメチルスルホキシド (10 mL) 中の 0.5 g (1.77 mmol) の 6 - ブロモ - 4 - プロポキシ - 1 - (2H) - フタラジノンの溶液に添加する。その後、0.385 g (1.94 mmol) の 1 - ヨード - 3 - メチルブタンを一滴ずつ添加し、その後、その混合物を室温で一晩攪拌する。その反応混合物を 50 mL の水に注入し、各場合 50 mL の酢酸エチルで 3 回抽出する。併せた有機相を各場合 50 mL の水で 2 回洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させて、減圧下で濃縮する。残留物を、石油エーテル / メチル t - ブチルエーテル (20 : 1) を使用するシリカゲルでのクロマトグラフィーに付す。これによって、14.2 g (理論値の 42.1%) の 6 - ブロモ - 2 - イソペンチル - 4 - プロポキシ - 1 (2H) - フタラジノンが得られる。

【0123】

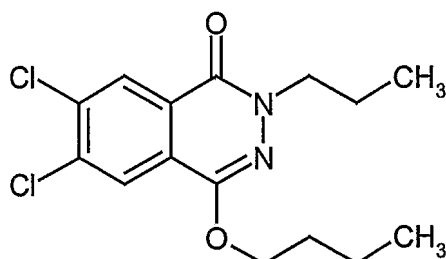
HPLC : log P = 5.91。

【0124】

(実施例 3)

【0125】

【化16】



10

20

30

40

50

## 【0126】

## 方法c)

0.043 g (0.77 mmol) の粉末水酸化カリウムを、ジメチルスルホキシド (5 mL) 中の 0.2 g (0.73 mmol) の 6,7-ジクロロ-4-ヒドロキシ-2-プロピル-1(2H)-フタラジノンの溶液に添加する。その後、0.27 g (1.46 mmol) のヨードブタンを一滴ずつ添加し、その後、その混合物を 50 で 6 時間攪拌する。その反応混合物を 50 mL の水に注入し、各場合 50 mL の酢酸エチルで 2 回抽出する。併せた有機相を各場合 50 mL の水で 2 回洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させて、減圧下で濃縮する。残留物を、シクロヘキサン/酢酸エチル (3:1) を使用するシリカゲルでのクロマトグラフィーに付す。これによって、0.2 g (理論値の 83%) の 4-ブトキシ-6,7-ジクロロ-2-プロピル-1(2H)-フタラジノンが得られる。

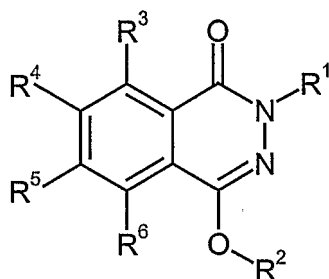
10

## 【0127】

下の表 1 に記載する式 (I) の化合物も、実施例 1 ~ 3 と類似に、また、方法 a)、b) および c) の一般説明に従って得ることができる。

## 【0128】

## 【化17】



(I)

20

## 【0129】

【表 1】

表 1

実施例 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	LogP '	融点 (°C)
1	n-ブチル	n-ブチル	-H	-Br	-H	H	4.76	
2	i-ペンチル	n-ブチル	-H	-Br	-H	-H	5.91	
3	n-ブチル	n-プロピル	-H	-Cl	-Cl	-H	xx	
4	n-ブチル	n-ブチル	-H	-H	-Br	-H	4.8	
5	n-プロピル	n-ブチル	-H	-Br	-H	-H	5.32	
6	アリル	n-ブチル	-H	-Br	-H	-H	4.32	
7	ブチルキル	n-ブチル	-H	-Br	-H	-H	3.82	
8	i-プロピル	n-ブチル	-H	-H	-Br	-H	5.33	
9	2-プロピル	2-プロピル	-H	-Br	-H	-H	5.52	
10	n-ブチル	n-ブチル	-H	-Cl	-Cl	-H	5.51	
11	n-プロピル	n-プロピル	-H	-Cl	-Cl	-H	6.71	
12	2-プロピル	2-プロピル	-H	-Cl	-Cl	-H	3.62	
13	i-プロピル	i-プロピル	-H	-Cl	-Cl	-H	6.46	
14	n-ブチル	-CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-H	-Cl	-Cl	-H		80
15	n-ブチル	n-ブチル	-H	-F	-O-n-propyl	-H	4.82	
16	n-ブチル	n-ブチル	-H	-O-n-propyl	-F	-H	5.26	
17	n-ブチル	n-プロピル	-H	-Br	-H	-H		
18	n-ブチル	n-プロピル	-H	-H	-Br	-H		72
19	n-ブチル	i-ブチル	-H	-Cl	-Cl	-H		98
20	n-ブチル	シクロペンチル	-H	-Cl	-Cl	-H		83
21	n-ブチル	シクロヘキシル-メチル	-H	-Cl	-Cl	-H		93
22	i-プロピル	n-ブチル	-H	-Cl	-Cl	-H		75
23	i-プロピル	n-プロピル	-H	-Cl	-Cl	-H		61
24	i-プロピル	i-ブチル	-H	-Cl	-Cl	-H		79
25	i-プロピル	シクロプロピル-メチル	-H	-Cl	-Cl	-H		75
26	i-プロピル	シクロヘキシル-メチル	-H	-Cl	-Cl	-H		69
27	2-メトキシエチル	n-ブチル	-H	-Cl	-Cl	-H		92
28	2-メトキシエチル	n-プロピル	-H	-Cl	-Cl	-H		89
29	2-メトキシエチル	i-ブチル	-H	-Cl	-Cl	-H		89
30	2-メトキシエチル	i-プロピル	-H	-Cl	-Cl	-H		73
31	2-メトキシエチル	シクロプロピル-メチル	-H	-Cl	-Cl	-H		105
32	2-メトキシエチル	シクロヘキシル-メチル	-H	-Cl	-Cl	-H		
33	n-ブチル	n-ブチル	-H	I	-H	-H		99
34	n-ブチル	n-ブチル	-H	-Br	-Br	-H		95
35	n-ブチル	n-ブチル	-H	-H	I	-H		60
36	n-ブチル	n-プロピル	-H	-Br	-Br	-H		113
37	n-プロピル	i-ブチル	-H	-Cl	-Cl	-H		
38	n-プロピル	i-プロピル	-H	-Cl	-Cl	-H		
39	n-プロピル	シクロプロピル-メチル	-H	-Cl	-Cl	-H		59
40	n-プロピル	シクロペンチル	-H	-Cl	-Cl	-H		
41	n-プロピル	シクロヘキシル-メチル	-H	-Cl	-Cl	-H		87

10

20

30

40

42	n-7°ピピル	2-メトキシエチル	-H	-Cl	-Cl	-H		100
43	n-7°ピピル	シクロヘキシル	-H	-Br	-Br	-H		121
44	n-7°ピピル	シクロ7°ピピル-メチル	-H	-Br	-Br	-H		109
45	n-7°ピピル	i-7°ピピル	-H	-Br	-Br	-H		93
46	n-7°ピピル	-i-7°ピピル	-H	-Br	-Br	-H		128
47	n-7°ピピル	i-7°ピピル	-H	I	-H	-H		102
48	n-7°ピピル	i-7°ピピル	-H	-H	I	-H		88
49	n-7°ピピル	シクロヘキシル-メチル	-H	I	-H	-H		85
50	n-7°ピピル	シクロヘキシル-メチル	-H	-H	I	-H		90
51	n-7°ピピル	-i-7°ピピル	-H	I	-H	-H		84
52	n-7°ピピル	-i-7°ピピル	-H	-H	I	-H		79
53	n-7°ピピル	シクロヘキシル-エチル	-H	-Br	-Br	-H		142

\*)logP 値は、EEC 通達 79/831 添付書類 V.A8 に従って、HPLC(傾斜法、アセトニトリル/0.1%の酸水溶液)により決定した。

\*\*\*)以下の化合物は、NMR 分光法によって特性付けした:

実施例番号(3)

<sup>1</sup>H-NMR(400MHz, DMSO) δ=0.89(t, 3H, -CH<sub>3</sub>), 3.95(t, 2H, -CH<sub>2</sub>-), 8.11(s, 1H, アリール-H)ppm.

実施例番号(17)

<sup>1</sup>H-NMR(400MHz, DMSO) δ=0.88(t, 3H, -CH<sub>3</sub>), 3.98(t, 2H, -CH<sub>2</sub>-), 7.89(d, 1H, アリール-H)ppm.

実施例番号(32)

<sup>1</sup>H-NMR(400MHz, DMSO) δ=3.23(s, 3H, -OCH<sub>3</sub>), 4.07(t, 2H, -OCH<sub>2</sub>-), 8.10(s, 1H, アリール-H)ppm.

実施例番号(37)

<sup>1</sup>H-NMR(400MHz, DMSO) δ=0.90(t, 3H, -CH<sub>3</sub>), 5.11(m, 1H, -OCH-), 8.07(s, 1H, アリール-H)ppm.

実施例番号(38)

<sup>1</sup>H-NMR(400MHz, DMSO) δ=0.90(t, 3H, -CH<sub>3</sub>), 4.02(d, 2H, -OCH<sub>2</sub>-), 8.09(s, 1H, アリール-H)ppm.

実施例番号(40)

<sup>1</sup>H-NMR(700MHz, DMSO) δ=0.90(t, 3H, -CH<sub>3</sub>), 5.23(m, 1H, -OCH-), 8.05(s, 1H, アリール-H)ppm.

【 0 1 3 0 】

式 ( I V ) の中間体の調製

【 0 1 3 1 】

( 実施例 ( I V - 1 ) )

【 0 1 3 2 】

10

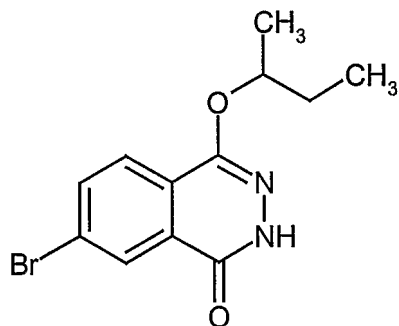
20

30

40



## 【化 18】



10

## 【0133】

## 方法 d)

1.73 g (26.1 mmol) の粉末水酸化カリウム (純度約 85%) を、ジメチルスルホキシド (90 mL) 中の 6 g (24.9 mmol) の 6-ブロモ-2,3-ジヒドロ-1,4-フタラジンジオンの溶液に添加する。その後、3.41 g (24.9 mmol) の 2-ブロモブタンを一滴ずつ添加し、その後、その混合物を室温で一晩攪拌する。その後、別の 0.49 g (7.47 mmol) の水酸化カリウムおよび 1.02 g (7.47 mmol) の 2-ブロモブタンを添加し、さらに 24 時間攪拌し続ける。その反応混合物を 400 mL の水に注入し、各場合 120 mL の酢酸エチルで 3 回抽出する。併せた有機相を各場合 150 mL の水で 2 回洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させて、減圧下で濃縮する。残留物を、石油エーテル/メチル t-ブチルエーテル (40:1 から 20:1) を使用するシリカゲルでのクロマトグラフィーに繰り返し付す。これによって、0.76 g (理論値の 10.3%) の 7-ブロモ-4-sec-ブトキシ-1(2H)-フタラジノンが得られる。

20

## 【0134】

HPLC: log P = 3.01。

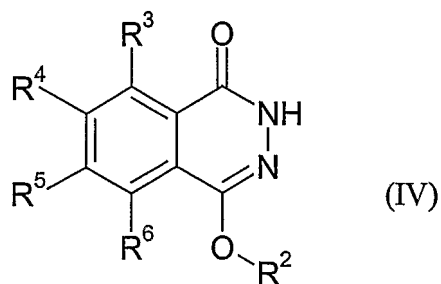
## 【0135】

下の表 2 に記載する式 (IV) の化合物は、実施例 (IV-1) と類似に、また、方法 d) の一般説明に従って得ることができる。

30

## 【0136】

## 【化 19】



(IV)

40

## 【0137】

【表 2】

表 2

実施例番号	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	LogP*
(IV-1)	2-ブチル	-H	-Br	-H	-H	3.01
(IV-2)	n-プロピル	-H	-Br	-H	-H	2.66
(IV-3)	n-プロピル	-H	-H	-Br	-H	2.71
(IV-4)	2-ブチル	-H	-H	-Br	-H	3.12
(IV-5)	2-ブチル	-H	-Cl	-Cl	-H	3.62
(IV-6)	i-ブチル	-H	-Cl	-Cl	-H	3.64

\* ) logP 値は、EEC 通達 79/831 添付書類 V.A8 に従って、HPLC(傾斜法、アセトリル/0.1%リン酸水溶液)により決定した。

10

【 0 1 3 8 】

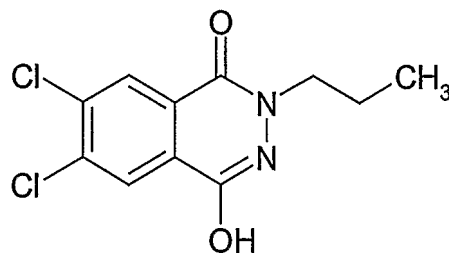
式 ( V ) の中間体の調製

【 0 1 3 9 】

( 実施例 ( V - 1 ) )

【 0 1 4 0 】

【 化 2 0 】



20

【 0 1 4 1 】

方法 e )

氷酢酸 ( 10 mL ) 中の 1.13 g ( 5.22 mmol ) の 5,6-ジクロロ-2-ベンゾフラン-1,3-ジオン、0.75 g ( 6.78 mmol ) の n-プロピルヒドラジンおよび 0.54 g の酢酸ナトリウムの混合物を 2 時間還流させながら加熱する。冷却後、100 mL の水はその反応混合物に添加し、得られた沈殿を濾過して除去し、約 30 mL の水で洗浄して、乾燥させた。これによって、融点 223 の 6,7-ジクロロ-4-ヒドロキシ-2-プロピル-1(2H)-フタラジノン 1.1 g ( 理論値の 77% ) が得られる。

30

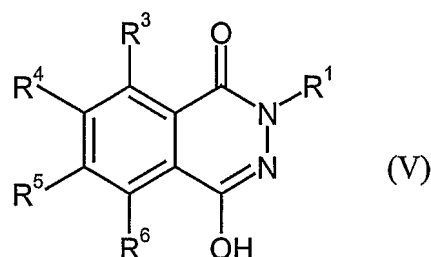
【 0 1 4 2 】

下の表 3 に記載する式 ( V ) の化合物は、実施例 ( V - 1 ) と類似に、また、方法 e ) の一般説明に従って得ることができる。

【 0 1 4 3 】

40

【 化 2 1 】



(V)

【 0 1 4 4 】

50

【表 3】

表 3

実施例番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	融点(°C)
(V-1)	n-7°ピピル	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	223
(V-2)	n-7°ピピル	-H	-H	-Br	-H	-H	162
(V-3)	イソブチル	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	217
(V-4)	2-メキシチル	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	223
(V-5)	アリル	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	207
(V-6)	n-7°ピピル	-H	-H	I	-H	-H	176
(V-7)	n-7°ピピル	-H	-H	-Br	-Br	-H	xx
(V-8)	n-7°チル	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	xx

10

## 【0145】

xx 以下の化合物は、NMR分光法によって特性付けした：

## 【0146】

実施例番号 (V-7)

<sup>1</sup>H-NMR (400 MHz, DMSO) = 0.88 (t, 3H, -CH<sub>3</sub>), 3.90 (t, 2H, -CH<sub>2</sub>-), 8.20 (s, 1H, アリール-H), 12.0 (s, 1H, -OH) ppm.

## 【0147】

20

実施例番号 (V-8)

<sup>1</sup>H-NMR (400 MHz, DMSO) = 0.90 (t, 3H, -CH<sub>3</sub>), 3.95 (t, 2H, -CH<sub>2</sub>-), 8.09 (s, 1H, アリール-H), 12.0 (s, 1H, -OH) ppm.

## 【0148】

(実施例 A)

エリシフェ属 (Erysiphe) 試験 (コムギ) / 保護試験

溶媒：N, N-ジメチルアセトアミド 25重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル 0.6重量部

活性化合物の適する調製物を製造するために、1重量部の活性化合物と示した量の溶媒および乳化剤とを混合し、その濃縮物を水で所望の濃度に希釈する。

30

## 【0149】

保護活性を試験するために、若い植物にこの活性化合物の調製物を規定の塗布率で噴霧する。

## 【0150】

噴霧皮膜が乾いたら、それらの植物に、コムギうどんこ病菌 (Erysiphe graminis f. sp. tritici) の胞子を散布する。

## 【0151】

それらの植物を、温度約20、相対大気湿度約80%の温室に置いて、うどんこ病ブステルの発生を促進する。

40

## 【0152】

評価は、接種から7日後に行う。0%は、対照のものに相当する有効度を意味し、これに対して100%の有効度は、感染が一切観察されないことを意味する。

## 【0153】

この試験において、実施例4、10および11の化合物は、500g/haの塗布率で、100%の有効度を示す。

## 【0154】

(実施例 B)

スファエロセカ属 (Sphaerotheca) 試験 (キュウリ) / 保護試験

溶媒：アセトン 24.5重量部

50

## ジメチルアセトアミド 24.5 重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル 1.0 重量部

活性化合物の適する調製物を製造するために、1 重量部の活性化合物と示した量の溶媒および乳化剤とを混合し、その濃縮物を水で所望の濃度に希釈する。

## 【0155】

保護活性を試験するために、若い植物にこの活性化合物の調製物を規定の塗布率で噴霧する。噴霧皮膜が乾いたら、それらの植物に、キュウリうどんこ病菌 (*Sphaerotheca fuliginea*) の胞子の水性浮遊液を接種する。それらの植物を、温度約 23、相対大気湿度約 70% の温室に置く。

## 【0156】

評価は、接種から 7 日後に行う。0% は、対照のものに相当する有効度を意味し、これに対して 100% の有効度は、感染が一切観察されないことを意味する。

## 【0157】

この試験において、実施例 (5)、(6) および (7) の化合物は、100 g/ha の塗布率で、95% 以上の有効度を示す。

## 【0158】

(実施例 C)

エリシフェ属 (*Erysiphe*) 試験 (キュウリ) / 保護試験

溶媒：N, N - ジメチルアセトアミド 25 重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル 0.6 重量部

活性化合物の適する調製物を製造するために、1 重量部の活性化合物と示した量の溶媒および乳化剤とを混合し、その濃縮物を水で所望の濃度に希釈する。

## 【0159】

保護活性を試験するために、若い植物にこの活性化合物の調製物を規定の塗布率で噴霧する。

## 【0160】

噴霧皮膜が乾いたら、それらの植物に、オオムギうどんこ病菌 (*Erysiphe graminis f. sp. hordei*) の胞子を散布する。

## 【0161】

それらの植物を、温度約 20、相対大気湿度約 80% の温室に置いて、うどんこ病ブ 30  
ステルの発生を促進する。

## 【0162】

評価は、接種から 7 日後に行う。0% は、対照のものに相当する有効度を意味し、これに対して 100% の有効度は、感染が一切観察されないことを意味する。

## 【0163】

この試験において、実施例 5、6 および 11 の化合物は、500 g/ha の塗布率で、100% の有効度を示す。

## 【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International Application No PCT/EP 02/09871
<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b> IPC 7 C07D237/32 A01N43/58		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
<b>B. FIELDS SEARCHED</b> Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 7 C07D A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) EPO-Internal, PAJ, WPI Data, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data		
<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 634 404 A (RHONE POULENC AGRICULTURE) 18 January 1995 (1995-01-18) page 15, line 20 - line 36	8
A	claims abstract	1-7,9-14
A	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1996, no. 12, 26 December 1996 (1996-12-26) & JP 08 198856 A (HOKKO CHEM IND CO LTD), 6 August 1996 (1996-08-06) cited in the application abstract	1-14
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of box C. <input checked="" type="checkbox"/> Patent family members are listed in annex.		
* Special categories of cited documents : *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance *E* earlier document but published on or after the international filing date *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art. *&* document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 21 November 2002		Date of mailing of the international search report 02/12/2002
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Stix-Malaun, E

1

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No  
PCT/EP 02/09871

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0634404	A	18-01-1995	AU 6735194 A	27-01-1995
			BG 98899 A	31-05-1995
			BR 9402264 A	14-03-1995
			CA 2127933 A1	14-01-1995
			CN 1103866 A	21-06-1995
			CZ 9401679 A3	15-02-1995
			EP 0634404 A1	18-01-1995
			FI 943317 A	14-01-1995
			HU 67328 A2	28-03-1995
			JP 7165730 A	27-06-1995
			PL 304272 A1	23-01-1995
			SK 82894 A3	08-02-1995
			ZA 9405095 A	22-02-1995
			-----	
JP 08198856	A	06-08-1996	NONE	
-----				

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/09871

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES IPK 7 C07D237/32 A01N43/58		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK		
B. RESEARCHIERTE GEBIETE		
Recherchiertes Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) IPK 7 C07D A01N		
Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, PAJ, WPI Data, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	EP 0 634 404 A (RHONE POULENC AGRICULTURE) 18. Januar 1995 (1995-01-18) Seite 15, Zeile 20 - Zeile 36	8
A	Ansprüche Zusammenfassung	1-7,9-14
A	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1996, no. 12, 26. Dezember 1996 (1996-12-26) & JP 08 198856 A (HOKKO CHEM IND CO LTD), 6. August 1996 (1996-08-06) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung	1-14
<input type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen <input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : *A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist *E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist *L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) *O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht *P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist *T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist *X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden *Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist *&* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts
21. November 2002		02/12/2002
Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter  Stix-Malaun, E

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Akdenzeichen  
PCT/EP 02/09871

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0634404	A	18-01-1995	AU 6735194 A 27-01-1995
			BG 98899 A 31-05-1995
			BR 9402264 A 14-03-1995
			CA 2127933 A1 14-01-1995
			CN 1103866 A 21-06-1995
			CZ 9401679 A3 15-02-1995
			EP 0634404 A1 18-01-1995
			FI 943317 A 14-01-1995
			HU 67328 A2 28-03-1995
			JP 7165730 A 27-06-1995
			PL 304272 A1 23-01-1995
			SK 82894 A3 08-02-1995
			ZA 9405095 A 22-02-1995
			JP 08198856



## フロントページの続き

(81) 指定国 AP(GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), EP(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, N O, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW

(72) 発明者 クリューガー, ベルント - ブイーラント  
ドイツ国、5 1 4 6 7・ベルギシユ・グラートバツハ、アム・フオレント・5 2

(72) 発明者 ウルマン, アストリツト  
ドイツ国、5 0 6 7 7・ケルン、メロピングエルシユトラーセ・3 1

(72) 発明者 ヒルブランド, シユテフアン  
ドイツ国、4 1 4 6 2・ノイス、ロートリンガー・シユトラーセ・2 2

(72) 発明者 マオラー - マハニク, アストリツト  
ドイツ国、4 2 7 9 9・ライヒリンゲン、ノイエンカムパー・ベーク・4 8

(72) 発明者 バツヘンドルフ - ノイマン, ウルリーケ  
ドイツ国、5 6 5 6 6・ノイビート、オーバラー・マルケンベーク・8 5

Fターム(参考) 4H011 AA01 BB09 DA16 DD03