

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第4782418号  
(P4782418)

(45) 発行日 平成23年9月28日(2011.9.28)

(24) 登録日 平成23年7月15日(2011.7.15)

(51) Int. Cl.		F I	
<b>CO7D 213/61</b>	<b>(2006.01)</b>	CO7D 213/61	CSP
<b>AO1N 25/30</b>	<b>(2006.01)</b>	AO1N 25/30	
<b>AO1N 43/40</b>	<b>(2006.01)</b>	AO1N 43/40	IO1A
<b>AO1P 3/00</b>	<b>(2006.01)</b>	AO1P 3/00	

請求項の数 18 (全 32 頁)

(21) 出願番号	特願2004-528509 (P2004-528509)	(73) 特許権者	503325538
(86) (22) 出願日	平成15年8月8日(2003.8.8)		バイエル・クロツプサイエンス・エス・ア ー
(65) 公表番号	特表2005-535714 (P2005-535714A)		フランス国、エフ-69009・リヨン、 リュ・ジャン-マリー・ルクレール、16
(43) 公表日	平成17年11月24日(2005.11.24)	(74) 代理人	100062007
(86) 国際出願番号	PCT/EP2003/009516		弁理士 川口 義雄
(87) 国際公開番号	W02004/016088	(74) 代理人	100114188
(87) 国際公開日	平成16年2月26日(2004.2.26)		弁理士 小野 誠
審査請求日	平成18年4月18日(2006.4.18)	(74) 代理人	100103920
(31) 優先権主張番号	02356159.0		弁理士 大崎 勝真
(32) 優先日	平成14年8月12日(2002.8.12)	(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
(31) 優先権主張番号	0305233	(74) 代理人	
(32) 優先日	平成15年4月29日(2003.4.29)		
(33) 優先権主張国	フランス (FR)		

最終頁に続く

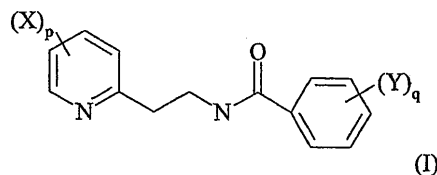
(54) 【発明の名称】 新規2-ピリジルエチルベンズアミド誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(I)：

【化1】



[式中、

- ・ p は、1、2、3 又は 4 に等しい整数であり；
- ・ q は、1、2、3、4 又は 5 に等しい整数であり；
- ・ 各置換基 X は、互いに独立して、ハロゲン、アルキル又はハロアルキルであるように選択されるが、該置換基の内の少なくとも 1 つは、ハロアルキルであり；
- ・ 各置換基 Y は、互いに独立して、ハロゲン、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシ、アミノ、フェノキシ、アルキルチオ、ジアルキルアミノ、アシル、シアノ、エステル、ヒドロキシ、アミノアルキル、ベンジル、ハロアルコキシ、ハロスルホニル、ハロチオアルキル、アルコキシアルケニル、アルキルスルホンアミド、ニトロ、アルキルスルホニル、フェニルスルホニル又はベンジルスルホニルであるように選択

される]

で表される化合物；又は

その 2 - ピリジンの N - オキシド；

但し、N - { 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 , 6 - ジクロロベンズアミドは除く。

【請求項 2】

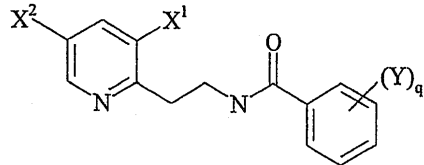
p が 2 であることを特徴とする、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

置換基 X の位置が以下のとおりであることを特徴とする、請求項 2 に記載の化合物。

【化 2】

10



【請求項 4】

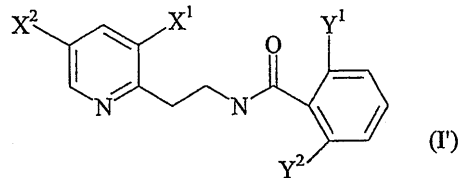
q が 1 又は 2 から選択され、置換基 Y が該ベンゼン環のオルト位に位置していることを特徴とする、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】

20

一般式 ( I ' ) :

【化 3】



に相当することを特徴とする、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

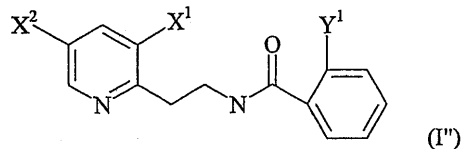
30

X<sup>1</sup> がハロゲンであり、且つ、X<sup>2</sup> がハロアルキルであることを特徴とする、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

一般式 ( I '' ) :

【化 4】



40

に相当することを特徴とする、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 8】

下記：

・ X<sup>1</sup> がハロゲンであるように選択され、且つ、X<sup>2</sup> がハロアルキルであるように選択される；

・ Y<sup>1</sup> がハロゲン又はハロアルキルであるように選択される；

という特徴を、個別的に又は組み合わせることを特徴とする、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

50

ハロアルキル基がトリフルオロメチルであることを特徴とする、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

前記式 (I') の化合物が、

- ・ N - { 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 - トリフルオロメチルベンズアミド ;
- ・ N - { 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 - ヨードベンズアミド ;

又は、

- ・ N - { 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 ;

10

であることを特徴とする、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

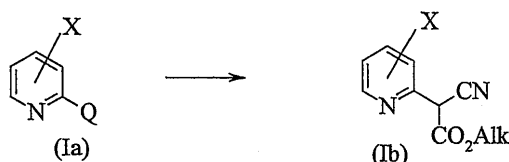
請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物を調製する方法であって、

・ 第一のステップ [ここで、該第一のステップでは、一般式 (Ia) の化合物の 2 位を選択的に置換するために、非プロトン性極性溶媒中で、塩基の存在下、一般式 (Ia) の化合物を、

\* シアノ酢酸アルキルタイプ (NC - CH<sub>2</sub> - CO<sub>2</sub>Alk) の基と反応させて、以下の反応スキーム :

【化 5】

20



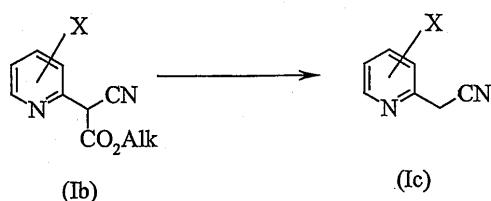
[ 上記反応スキーム中、

- ・ X は、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項で定義されているとおりであり ;
- ・ Alk は、アルキルラジカルを表し ;
- ・ Q は、離核性ラジカルである ]

30

に従って一般式 (Ib) の化合物を生成させ、得られた一般式 (Ib) の化合物を、次いで、Krapcho 反応により、ハロゲン化リチウム、ハロゲン化カリウム及びハロゲン化ナトリウムからなる群から選択されるアルカリ金属ハロゲン化物の存在下、水/ジメチルスルホキシド混合物の還流下で、脱アルキルオキシ - カルボニル化に付して、以下の反応スキーム :

【化 6】

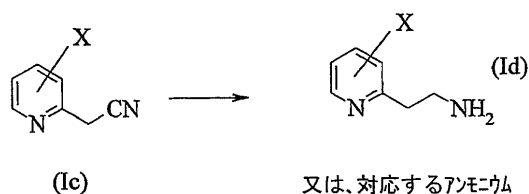


40

に従って一般式 (Ic) の化合物を生成させ ;

- ・ 第二のステップ [ここで、該第二のステップでは、以下の反応スキーム :

## 【化 7】



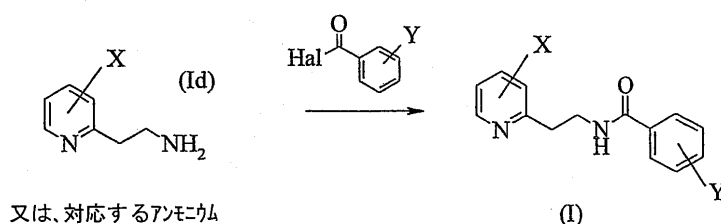
に従い、プロトン性溶媒中で、金属触媒の存在下、水素圧下で、一般式 ( I c ) の化合物を還元して一般式 ( I d ) のピリジルエタンアミン ( 又は、媒質が酸であるか否かに応じて、その対応するアンモニウム塩 ) とする ] ;

10

及び、

・ 第三のステップ [ ここで、該第三のステップでは、塩基の存在下、一般式 ( I d ) の化合物を、ハロゲン化ベンゾイルと反応させることにより、以下の反応スキーム :

## 【化 8】



20

[ 上記反応スキーム中、Y は、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項で定義されているとおりであり、Hal はハロゲンである ]

に従って一般式 ( I ) の化合物に変換する ] ;

を含むことを特徴とする、前記方法。

## 【請求項 1 2】

前記離核性ラジカル Q が、ハロゲン又はトリフルオロメタンスルホネートであることを特徴とする、請求項 1 1 に記載の方法。

## 【請求項 1 3】

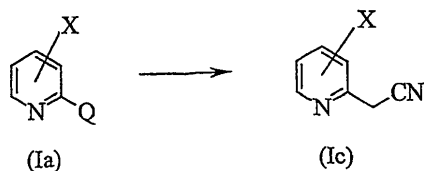
請求項 1 ~ 1 0 のいずれか 1 項に記載の化合物を調製する方法であって、

30

・ 第一のステップ [ ここで、該第一のステップでは、一般式 ( I a ) の化合物の 2 位を選択的に置換するために、非プロトン性極性溶媒中で、塩基の存在下、一般式 ( I a ) の化合物を、

\* アセトニトリルと反応させて、以下の反応スキーム :

## 【化 9】

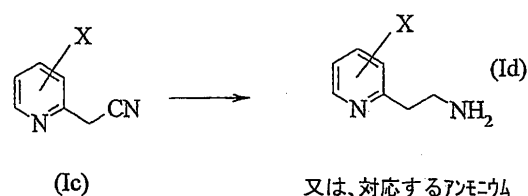


40

に従って一般式 ( I c ) の化合物を直接生成させる ] ;

・ 第二のステップ [ ここで、該第二のステップでは、以下の反応スキーム :

## 【化 1 0】



に従い、プロトン性溶媒中で、金属触媒の存在下、水素圧下で、一般式 ( I c ) の化合物

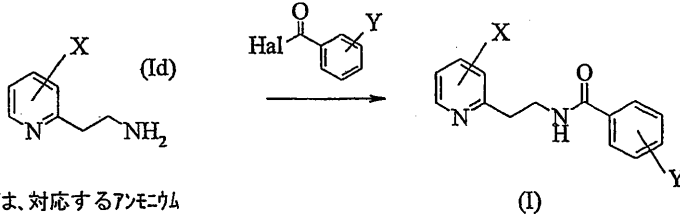
50

を還元して一般式 ( I d ) のピリジルエタンアミン ( 又は、媒質が酸であるか否かに応じて、その対応するアンモニウム塩 ) とする ] ;

及び、

・ 第三のステップ [ ここで、該第三のステップでは、塩基の存在下、一般式 ( I d ) の化合物を、ハロゲン化ベンゾイルと反応させることにより、以下の反応スキーム :

【化 1 1】



10

[ 上記反応スキーム中、Y は、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項で定義されているとおりであり、Hal はハロゲンである ]

に従って一般式 ( I ) の化合物に変換する ] ;

を含むことを特徴とする、前記方法。

【請求項 1 4】

前記離核性ラジカル Q が、ハロゲン又はトリフルオロメタンスルホネートであることを特徴とする、請求項 1 3 に記載の方法。

【請求項 1 5】

有効量の請求項 1 ~ 1 0 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有している殺菌剤組成物。

20

【請求項 1 6】

さらに界面活性剤を含有している、請求項 1 5 に記載の殺菌剤組成物。

【請求項 1 7】

0 . 0 5 ~ 9 9 重量 % の活性物質を含んでいる、請求項 1 5 又は 1 6 のいずれかに記載の殺菌剤組成物。

【請求項 1 8】

作物の植物病原性菌類を予防的又は治療的に防除する方法であって、有効で且つ植物に対して毒性を示さない量の請求項 1 5 ~ 1 7 のいずれかに記載の組成物を、植物の種子、植物の葉及び / 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ことを望む土壤に施用することを特徴とする、前記方法。

30

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0 0 0 1】

本発明は、新規殺菌性化合物、それらを調製する方法、それら化合物を含有している殺菌剤組成物、及び、農業分野における殺菌剤としてのそれらの使用に関する。

【背景技術】

【0 0 0 2】

特許出願 W O 0 1 / 1 1 9 6 5 号には、本発明化合物を包含する一般式で表される広範な一群の殺菌性化合物が記載されている。しかしながら、前記特許出願には、本発明化合物は記述されておらず、また、それらの殺菌剤としての活性は試験されていない。

40

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0 0 0 3】

しかし、既に知られている化合物の有効性と少なくとも同等の有効性を維持しながら、同時に、農業従事者が使用することになる活性物質の量を低減させるために、当業者に既に知られている化合物よりもさらに活性が高い化合物を使用することは、農業分野においては、常に有用である。

【課題を解決するための手段】

50

## 【 0 0 0 4 】

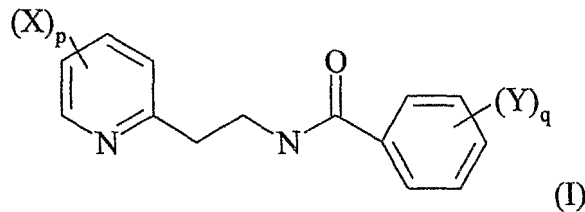
広範な一群の化合物から選択された一定の化合物が上記で挙げた利点を有していることが見いだされた。

## 【 0 0 0 5 】

従って、本発明の主題は、一般式 ( I ) :

## 【 0 0 0 6 】

## 【 化 1 0 】



10

[ 式中、

- ・ p は、1、2、3 又は 4 に等しい整数であり；
- ・ q は、1、2、3、4 又は 5 に等しい整数であり；
- ・ 各置換基 X は、互いに独立して、ハロゲン、アルキル又はハロアルキルであるように選択されるが、該置換基の内の少なくとも 1 つは、ハロアルキルであり；
- ・ 各置換基 Y は、互いに独立して、ハロゲン、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、アルコキシ、アミノ、フェノキシ、アルキルチオ、ジアルキルアミノ、アシル、シアノ、エステル、ヒドロキシ、アミノアルキル、ベンジル、ハロアルコキシ、ハロスルホニル、ハロチオアルキル、アルコキシアルケニル、アルキルスルホンアミド、ニトロ、アルキルスルホニル、フェニルスルホニル又はベンジルスルホニルであるように選択される]

20

で表される一群の殺菌性化合物、及び、その 2 - ピリジンの N - オキシド (但し、N - { 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 , 6 - ジクロロベンズアミドは除く) である。

## 【 発明を実施するための最良の形態 】

30

## 【 0 0 0 7 】

本発明に関連して、理解を容易にする目的で、2 - ピリジンの置換基 X 及びベンゼン環の置換基 Y に添え字を付ける。従って、例えば、p が 2 に等しく、q が 1 に等しい場合、「X」で表されている置換基を X<sup>1</sup> 及び X<sup>2</sup> で示し、「Y」で表されている置換基を Y<sup>1</sup> で示す。

## 【 0 0 0 8 】

本発明において、ハロゲンは、塩素、臭素、ヨウ素又はフッ素を意味する。

## 【 0 0 0 9 】

本発明において、該分子内に存在するアルキルラジカル又はアシルラジカルは、1 ~ 10 個の炭素原子、好ましくは、1 ~ 7 個の炭素原子、さらに好ましくは、1 ~ 5 個の炭素原子を含んでいて、直鎖又は分枝鎖であり得る。

40

## 【 0 0 1 0 】

本発明において、該分子内に存在するアルケニルラジカル又はアルキニルラジカルは、2 ~ 10 個の炭素原子、好ましくは、2 ~ 7 個の炭素原子、さらに好ましくは、2 ~ 5 個の炭素原子を含んでいて、直鎖又は分枝鎖であり得る。

## 【 0 0 1 1 】

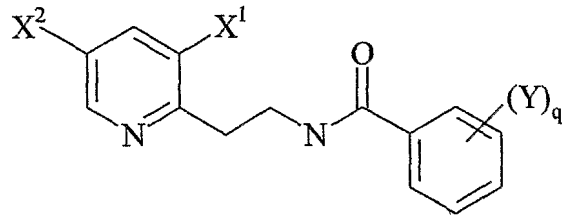
本発明は、一般式 ( I ) で表される化合物に関する。一般式 ( I ) の化合物は、優先的に、以下の特性を個別的に又は組み合わせで有する：

- ・ p は 2 に等しくなるように選択されて、置換基 X<sup>1</sup> 及び X<sup>2</sup> は、下記のような位置に存在している：

50

【 0 0 1 2 】

【 化 1 1 】



10

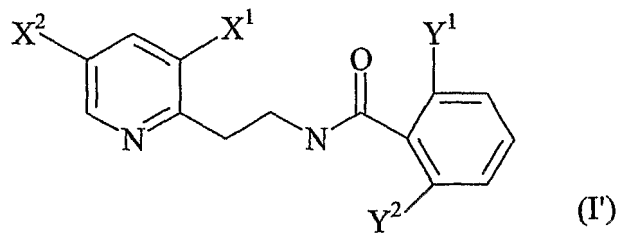
・ q は 1 又は 2 に等しくなるように選択されて、置換基 Y は、ベンゼン環のオルト位に存在している。

【 0 0 1 3 】

本発明化合物の好ましい亜群は、一般式 ( I ' ) に対応する化合物からなる。

【 0 0 1 4 】

【 化 1 2 】



20

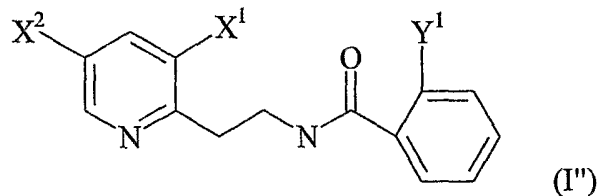
X 及び Y は、上記で定義されているとおりである。さらに好ましくは、X<sup>1</sup> は、ハロゲンであるように選択され、X<sup>2</sup> は、ハロアルキルであるように選択される。

【 0 0 1 5 】

本発明化合物の好ましい別の亜群は、一般式 ( I '' ) に対応する化合物からなる。

【 0 0 1 6 】

【 化 1 3 】



40

置換基 X 及び Y は、上記で定義されているとおりである。さらに好ましくは、本発明の一般式 ( I '' ) の化合物は、以下の特性を個別的に又は組み合わせて有する：

・ X<sup>1</sup> は、ハロゲンであるように選択され、X<sup>2</sup> は、ハロアルキルであるように選択される；

・ Y<sup>1</sup> は、ハロゲン又はハロアルキルであるように選択される。

【 0 0 1 7 】

さらに好ましくは、該ハロアルキル基は、トリフルオロメチルであるように選択される。

。

50

## 【0018】

さらに好ましくは、本発明の主題は、以下の化合物である：

- ・ N - { 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 - トリフルオロメチルベンズアミド；
- ・ N - { 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 - ヨードベンズアミド；
- ・ N - { 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 - ブロモベンズアミド。

## 【0019】

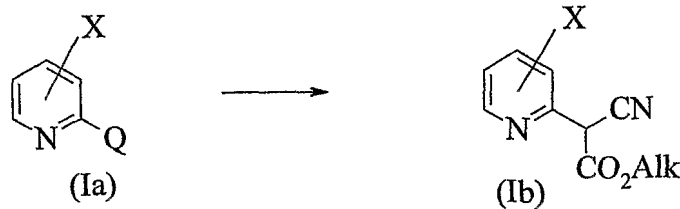
本発明は、さらにまた、一般式 ( I ) の化合物を調製する方法にも関する。従って、本発明のさらに別の態様により、上記で定義されている式 ( I ) の化合物を調製する方法が提供され、該方法は、

・ 第一のステップ〔ここで、該第一のステップでは、一般式 ( I a ) の化合物の 2 位を選択的に置換するために、非プロトン性極性溶媒中で、塩基の存在下、一般式 ( I a ) の化合物を、

\* シアノ酢酸アルキルタイプ (  $\text{NC} - \text{CH}_2 - \text{CO}_2\text{Alk}$  ) の基と反応させて、以下の反応スキーム：

## 【0020】

## 【化14】



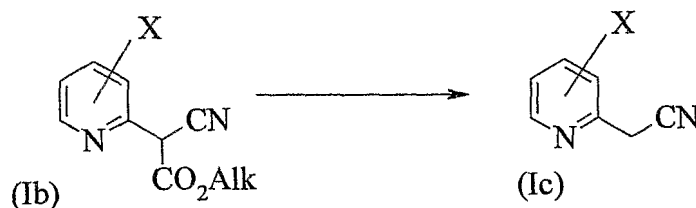
[ 上記反応スキーム中、

- ・ X は、先に定義されているとおりであり；
- ・ Alk は、アルキルラジカルを表し；
- ・ Q は、離核性 ( nucleofugal ) ラジカルであり、好ましくは、ハロゲン又はトリフルオロメタンスルホネートであるように選択される ]

に従って一般式 ( I b ) の化合物を生成させ、得られた一般式 ( I b ) の化合物を、次いで、A . P . S y n t h e s i s , 1 9 8 2 , 8 0 5 , 8 9 3 に記載されている K r a p c h o 反応により、ハロゲン化リチウム、ハロゲン化カリウム又はハロゲン化ナトリウムのようなアルカリ金属ハロゲン化物の存在下、水 / ジメチルスルホキシド混合物の還流下で、脱アルキルオキシ - カルボニル化に付して、以下の反応スキーム：

## 【0021】

## 【化15】



( ここで、本発明に関連して、ハロゲン化ナトリウムが優先的に使用される )



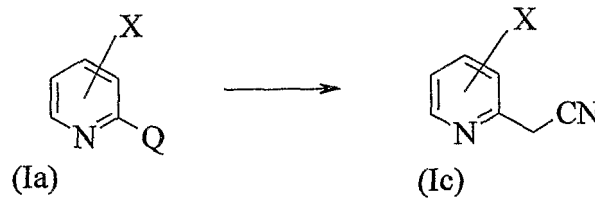
に従って一般式 ( I c ) の化合物を生成させるか ;

又は、

\* アセトニトリルと反応させて、以下の反応スキーム :

【 0 0 2 2 】

【 化 1 6 】



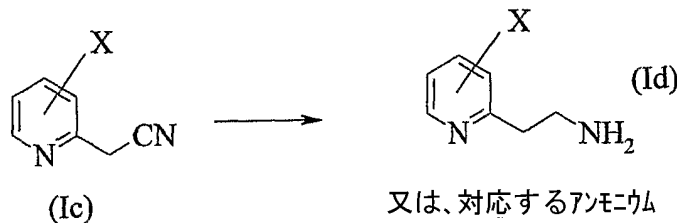
10

に従って一般式 ( I c ) の化合物を直接生成させる) ;

・ 第二のステップ [ ここで、該第二のステップでは、以下の反応スキーム :

【 0 0 2 3 】

【 化 1 7 】



20

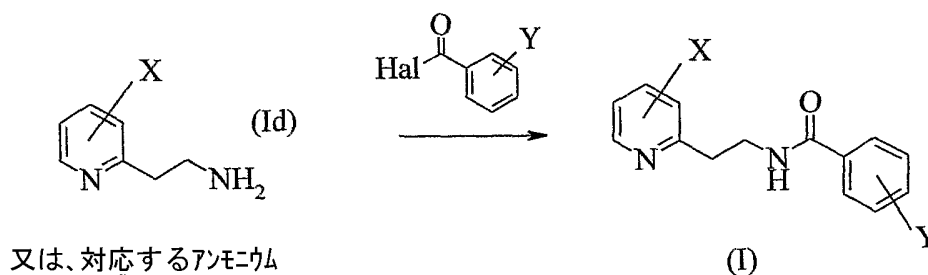
に従い、プロトン性溶媒中で、金属触媒の存在下、水素圧下で、一般式 ( I c ) の化合物を還元して一般式 ( I d ) のピリジルエタンアミン ( 又は、媒質が酸であるか否かに応じて、その対応するアンモニウム塩 ) とする) ;

及び、

・ 第三のステップ [ ここで、該第三のステップでは、塩基の存在下、一般式 ( I d ) の化合物をハロゲン化ベンゾイルと反応させることにより、一般式 ( I d ) の化合物を、以下の反応スキーム :

【 0 0 2 4 】

【 化 1 8 】



40

に従って一般式 ( I ) の化合物に変換する) ;

を含む。

【 0 0 2 5 】

上記調製方法の第二のステップは、金属触媒の存在下で行う。好ましくは、該金属触媒

50

は、ニッケル系触媒、白金系触媒又はパラジウム系触媒であるように選択される。

【0026】

上記調製方法の第三のステップは、ハロゲン化ベンゾイルの存在下で行う。好ましくは、該ハロゲン化ベンゾイルは、塩化ベンゾイルであるように選択される。

【0027】

上記調製方法により得た一般式(I)の化合物から、当業者は、当業者に公知の方法により、2-ピリジンのN-オキッド誘導体を調製することができるであろう。例えば、本発明の方法により得た一般式(I)の化合物を、例えばクロロホルムのような溶媒の存在下、60~80の範囲であり得る温度において、過剰量のメタ-クロロ過安息香酸(これは、m-CPBAとも称される)で処理することができる。

10

【0028】

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。従って、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。

【0029】

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、クレイ、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。

20

【0030】

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、リゲノスルホン酸塩、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、エチレンオキッドと脂肪アルコールの重縮合物、エチレンオキッドと脂肪酸の重縮合物若しくはエチレンオキッ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、スルホン酸官能基又はリン酸官能基を有して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、界面活性剤の量は、該組成物の5~40重量%であり得る。

30

40

【0031】

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。

【0032】

一般に、本発明の組成物は、0.05~99重量%、好ましくは、10~70重量%の活性物質を含有することができる。

【0033】

本発明の組成物は、エアゾルディスペンサー(aerosol dispenser)、マイクロカプセ

50

ル懸濁液 (capsule suspension)、冷煙霧剤 (cold fogging concentrate)、散粉性粉剤 (dustable powder)、乳剤 (emulsifiable concentrate)、水中油型エマルジョン剤 (emulsion oil in water)、油中水型エマルジョン剤 (emulsion water in oil)、カプセル化粒剤 (encapsulated granule)、細粒剤 (fine granule)、種子処理用フロアブル剤 (flowable concentrate for seed treatment)、ガス剤 (gas) (加圧下)、ガス生成剤 (gas generating product)、粒剤 (granule)、温煙霧剤 (hot fogging concentrate)、大型粒剤 (macrogranule)、微粒剤 (microgranule)、油分散性粉剤 (oil dispersible powder)、油混和性フロアブル剤 (oil miscible flowable concentrate)、油混和性液剤 (oil miscible liquid)、ペースト剤 (paste)、植物用棒状剤 (plant rodlet)、乾燥種子処理用粉剤 (powder for dry seed treatment)、農薬粉衣種子 (seed coated with a pesticide)、可溶性濃厚剤 (soluble concentrate)、可溶性粉剤 (soluble powder)、種子処理用溶液剤 (solution for seed treatment)、懸濁液剤 (suspension concentrate) (フロアブル剤 (flowable concentrate))、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 (water dispersible granule)、水分散性錠剤 (water dispersible tablet)、泥水処理用水和剤 (water dispersible powder for slurry treatment)、水溶性顆粒剤 (water soluble granule)、水溶性錠剤 (water soluble tablet)、種子処理用水溶性粉剤 (water soluble powder for seed treatment)、及び、水和剤 (wetttable powder) のような、さまざまな形態で使用することが可能である。

10

## 【0034】

20

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により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市販の濃厚組成物も包含される。

## 【0035】

さらにまた、本発明の化合物は、1種以上の殺虫剤、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。

## 【0036】

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。従って、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、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壌若しくは植物を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。

30

## 【0037】

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

## 【0038】

「有効で且つ植物に対して毒性を示さない量 (effective and non-phytotoxic amount)」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、作物のタイプ、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

## 【0039】

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。

## 【0040】

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。

【0041】

本発明の方法により保護することが可能な植物の中で、以下のものを挙げることができる：ワタ；アマ；ブドウ；果実作物、例えば、Rosaceae sp.（例えば、種子果 (pip fruit)、例えば、リンゴ及びナシ、さらに、石果、例えば、アンズ、アーモンド及びモモ）、Ribesioideae sp.、Juglandaceae sp.、Betulaceae sp.、Anacardiaceae sp.、Fagaceae sp.、Moraceae sp.、Oleaceae sp.、Actinidaceae sp.、Lauraceae sp.、Musaceae sp.（例えば、バナナの木及び植栽地 (plantins)）、Rubiaceae sp.、Theaceae sp.、Sterculiaceae sp.、Rutaceae sp.（例えば、レモン、オレンジ及びグレープフルーツ）；マメ科作物、例えば、Solanaceae sp.（例えば、トマト）、Liliaceae sp.、Asteraceae sp.（例えば、レタス）、Umbelliferae sp.、Cruciferae sp.、Chenopodiaceae sp.、Cucurbitaceae sp.、Papilionaceae sp.（例えば、エンドウ）、Rosaceae sp.（例えば、イチゴ）；大型作物 (big crop)、例えば、Graminae sp.（例えば、トウモロコシ、禾穀類、例えば、コムギ、イネ、オオムギ及びライコムギ）、Asteraceae sp.（例えば、ヒマワリ）、Cruciferae sp.（例えば、ナタネ）、Papilionaceae sp.（例えば、ダイズ）、Solanaceae sp.（例えば、ジャガイモ）、Chenopodiaceae sp.（例えば、ピーツ）；園芸作物及び森林作物 (forest crops)；さらに、これら作物の遺伝的に修飾された相同体。

【0042】

本発明の方法により保護される植物及びそれら植物の可能性のある病害の中で、以下のものを挙げることができる：

・ コムギ〔以下に示す種子の病害の防除に関して〕：フザリア (fusaria) (Microdochium nivale、及び、Fusarium roseum)、なまぐさ黒穂病 (Tilletia caries、Tilletia controversa、又は、Tilletia indica)、セプトリア病 (Septoria nodorum)、及び、裸黒穂病；

・ コムギ〔以下に示すコムギ植物の地上部の病害の防除に関して〕：穀類眼紋病 (cereal eyespot) (Tapesia yellundae、Tapesia acuiformis)、立枯病 (Gaeumannomyces graminis)、赤かび病 (foot blight) (F. culmorum、F. graminearum)、ブラックスペック (black speck) (Rhizoctonia cerealis)、うどんこ病 (Erysiphe graminis forma specie tritici)、さび病 (Puccinia striiformis、及び、Puccinia recondita)、及び、セプトリア病 (Septoria tritici、及び、Septoria nodorum)；

・ コムギ及びオオムギ〔細菌病及びウイルス病の防除に関して〕：例えば、オオムギ縞萎縮病 (barley yellow mosaic)；

・ オオムギ〔以下に示す種子の病害の防除に関して〕：網斑病 (Pyrenophora graminea、Pyrenophora teres、及び、Cochliobolus sativus)、裸黒穂病 (Ustilago nuda)、及び、フザリア (fusaria) (Microdochium nivale、及び、Fusarium roseum)；

・ オオムギ〔以下に示すオオムギ植物の地上部の病害の防除に関して〕：穀類眼紋病 (

10

20

30

40

50

cereal eyespot) (*Tapesia yellundae*)、網斑病 (*Pyrenophora teres*、及び、*Cochliobolus sativus*)、うどんこ病 (*Erysiphe graminis forma specie hordei*)、小さび病 (*Puccinia hordei*)、及び、雲形病 (*Rhynchosporium secalis*) ;

・ ジャガイモ〔塊茎の病害の防除に関して〕 : (特に、*Helminthosporium solani*、*Phoma tuberosa*、*Rhizoctonia solani*、*Fusarium solani*)、べと病 (*Phytophthora infestans*)、及び、特定のウイルス(ウイルスY) ;

・ ジャガイモ〔以下に示す茎葉部の病害の防除に関して〕 : 夏疫病 (*Alternaria solani*)、べと病 (*Phytophthora infestans*) ;

・ ワタ〔種子から生育した幼植物の以下に示す病害の防除に関して〕 : 立枯病及び地際部腐敗 (collar rot) (*Rhizoctonia solani*、*Fusarium oxysporum*)、及び、黒根腐病 (black root rot) (*Thielaviopsis basicola*) ;

・ 蛋白質産作物 (protein yielding crop)、例えば、エンドウ〔以下に示す種子の病害の防除に関して〕 : 炭疽病 (*Ascochyta pisi*、*Mycosphaerella pinodes*)、フザリア (fusaria) (*Fusarium oxysporum*)、灰色かび病 (*Botrytis cinerea*)、及び、べと病 (*Peronospora pisi*) ;

・ 油料作物 (oil-bearing crop)、例えば、ナタネ〔以下に示す種子の病害の防除に関して〕 : *Phoma lingam*、*Alternaria brassicae*、及び、*Sclerotinia sclerotiorum* ;

・ トウモロコシ〔種子の病害の防除に関して〕 : (*Rhizopus sp.*、*Penicillium sp.*、*Trichoderma sp.*、*Aspergillus sp.*、及び、*Gibberella fujikuroi*) ;

・ アマ〔種子の病害の防除に関して〕 : *Alternaria linicola* ;

・ 森林樹〔立枯病の防除に関して〕 : (*Fusarium oxysporum*、*Rhizoctonia solani*) ;

・ イネ〔以下に示す地上部の病害の防除に関して〕 : いもち病 (*Magnaporthe grisea*)、紋枯病 (bordered sheath spot) (*Rhizoctonia solani*) ;

・ マメ科作物〔種子又は種子から生育した幼植物の以下に示す病害の防除に関して〕 : 立枯病及び地際部腐敗 (collar rot) (*Fusarium oxysporum*、*Fusarium roseum*、*Rhizoctonia solani*、*Pythium sp.*) ;

・ マメ科作物〔以下に示す地上部の病害の防除に関して〕 : 灰色かび病 (*Botrytis sp.*)、うどんこ病 (特に、*Erysiphe cichoracearum*、*Sphaerotheca fuliginea*、及び、*Leveillula taurica*)、フザリア (fusaria) (*Fusarium oxysporum*、*Fusarium roseum*)、斑点病 (*Cladosporium sp.*)、褐点病 (alternaria leaf spot) (*Alternaria sp.*)、炭疽病 (*Colletotrichum sp.*)、セプトリア斑点病 (septoria leaf spot) (*Septoria sp.*)、ブラックスペック (black speck) (*Rhizoctonia solani*)、べと病 (例えば、*Bremia lactucae*、*Peronospora sp.*、*Pseudoperonospora sp.*、*Phytophthora sp.*) ;

・ 果樹〔地上部の病害に関して〕 : モニリア病 (*Monilia fructigenae*、*M. laxa*)、黒星病 (*Venturia inaequalis*)、うどんこ病 (*Podosphaera leucotricha*) ;

10

20

30

40

50

- ・ ブドウ〔茎葉部の病害に関して〕：特に、灰色かび病 (*Botrytis cinerea*)、うどんこ病 (*Uncinula necator*)、黒腐病 (*Guignardia biwelli*)、及び、べと病 (*Plasmopara viticola*) ;
- ・ ビーツ〔以下に示す地上部の病害に関して〕：サーコスポラ葉枯病 (*Cercospora beticola*)、うどんこ病 (*Erysiphe beticola*)、斑点病 (*Ramularia beticola*)。

## 【0043】

本発明の殺菌剤組成物は、木材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」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、直接的な施用、噴霧、浸漬、注入、又は、別の適切な任意の方法が包含される。

10

## 【0044】

本発明の処理において通常使用される活性物質の薬量は、一般に、また、有利には、茎葉処理における施用では、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基づいて、該施用薬量を適合させる方法を理解するであろう。

20

## 【0045】

さらにまた、遺伝的に修飾されている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、本発明の殺菌剤組成物を使用することができる。遺伝的に修飾されている植物は、所定の蛋白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。「所定の蛋白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遺伝子を意味する。

30

## 【0046】

さらにまた、本発明の組成物は、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、*Aspergillus spp.* (例えば、*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ために使用することもできる。

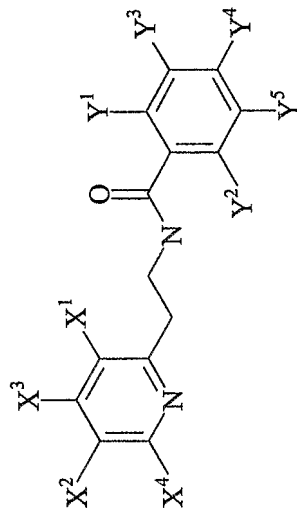
## 【0047】

本発明の態様について、化合物についての下記表及び実施例を参照して例証する。以下の表A及び表B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」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又はマイナス1a.m.u. (原子質量単位) を意味し、「M(ApCI+)」は、質量分析において、正の大気圧化学イオン化 (positive atmospheric pressure chemical ionisation) により得られた分子イオンピークを意味する。

40

## 【0048】

【表 1】



化合物No.	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	M+1
A-1	H	CF <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	363
A-2	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	H	H	363
A-3	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	Cl	Cl	397
A-4	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	H	H	H	H	347
A-5	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	H	H	F	H	365
A-6	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	Cl	H	397
A-7	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OMe	H	H	H	H	359
A-8	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OMe	OMe	H	H	H	389
A-9	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	H	H	H	343
A-10	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	F	H	H	347
A-11	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	Cl	H	H	363
A-12	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	OMe	H	H	359
A-13	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	OMe	OMe	H	389
A-14	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	OMe	H	OMe	389

表A

10

20

30

40

化合物No.	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	M+1
A-15	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	F	H	347
A-16	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	OMe	H	359
A-17	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	OBu	H	401
A-18	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	397
A-19	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	Me	H	343
A-20	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	397
A-21	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	Et	H	357
A-22	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	Pr	H	371
A-23	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	Bu	H	385
A-24	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	C <sub>3</sub> H <sub>11</sub>	H	399
A-25	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	F	H	H	H	365
A-26	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	Me	H	H	343
A-27	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	377
A-28	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	397
A-29	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H	H	374
A-30	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	H	374
A-31	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	374
A-32	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	Cl	H	Cl	396
A-33	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	H	H	H	F	365
A-34	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	F	F	365
A-35	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	F	H	F	365



化合物No.	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	M+1
A-36	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	CN	H	H	354
A-37	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	Me	H	Me	H	371
A-38	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	NO <sub>2</sub>	Me	H	388
A-39	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	CO <sub>2</sub> Me	H	387
A-40	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	F	F	H	H	383
A-41	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	H	H	F	F	383
A-42	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	F	H	F	H	383
A-43	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	H	F	F	F	401
A-44	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	Cl	H	H	H	382
A-45	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	I	H	H	H	H	455
A-46	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	H	H	H	407
A-47	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	F	H	H	413
A-48	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	Cl	H	H	397
A-49	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	H	Cl	397
A-50	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	NHCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	358
A-51	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OMe	H	OMe	H	H	389
A-52	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OH	H	H	H	H	345
A-53	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OH	H	Me	H	H	359
A-54	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OH	H	H	Cl	H	379
A-55	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OH	H	H	OMe	H	375
A-56	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OH	H	H	Me	H	359

化合物No.	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	M+1
A-57	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OH	H	H	H	F	363
A-58	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OH	H	H	H	OMe	375
A-59	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OH	H	H	H	Me	359
A-60	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	Me	H	H	357
A-61	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	H	Me	H	357
A-62	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	H	H	Me	357
A-63	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OH	H	Cl	H	H	379
A-64	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	H	Cl	H	H	381
A-65	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OH	F	H	H	H	363
A-66	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	Cl	H	H	377
A-67	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	F	H	H	361
A-68	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OH	H	H	F	H	363
A-69	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	H	H	H	Cl	381
A-70	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	OH	H	H	359
A-71	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	H	H	OMe	436
A-72	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CF <sub>3</sub>	465
A-73	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	F	H	415
A-74	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	465
A-75	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	CF <sub>3</sub>	Cl	H	H	449
A-76	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	PhCH <sub>2</sub>	H	H	H	H	419
A-77	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	NO <sub>2</sub>	H	H	388

化合物No.	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	M+I
A-78	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	NO <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	433
A-79	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	H	H	NO <sub>2</sub>	388
A-80	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	H	Br	H	421
A-81	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	OMe	H	H	373
A-82	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OMe	H	OMe	OMe	H	419
A-83	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OMe	H	H	OMe	H	389
A-84	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OMe	H	H	OMe	OMe	419
A-85	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OMe	H	H	H	OMe	389
A-86	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OEt	H	H	H	H	373
A-87	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OMe	H	H	Cl	H	393
A-88	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OMe	H	H	H	Cl	393
A-89	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OCF <sub>3</sub>	H	H	H	H	413
A-90	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OMe	H	H	H	F	377
A-91	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OPr	H	H	H	H	387
A-92	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OMe	H	H	H	t-Bu	415
A-93	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	H	Br	441
A-94	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	I	H	I	H	I	397
A-95	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	NO <sub>2</sub>	H	H	408
A-96	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	NO <sub>2</sub>	H	408
A-97	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	H	NO <sub>2</sub>	408
A-98	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	H	SO <sub>2</sub> F	445

化合物No.	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	M+1
A-99	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	H	SMe	409
A-100	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	H	H	Cl	441
A-101	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	NO <sub>2</sub>	H	Cl	442
A-102	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	H	H	Br	485
A-103	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	Cl	H	Cl	431
A-104	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	H	CF <sub>3</sub>	431
A-105	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	NO <sub>2</sub>	H	H	452
A-106	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	Cl	F	415
A-107	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	F	F	399
A-108	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	OMe	OMe	H	423
A-109	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	H	H	NO <sub>2</sub>	452
A-110	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	H	Cl	H	441
A-111	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	Cl	H	H	441
A-112	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	Br	H	H	H	425
A-113	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	F	F	H	H	399
A-114	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Et	H	H	H	H	357
A-115	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	H	Me	CO <sub>2</sub> Et	429
A-116	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	Me	H	Cl	391
A-117	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	H	F	H	361
A-118	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	Cl	F	H	395

化合物No.	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	M+1
A-119	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	O-CF <sub>2</sub> - CHFCI	H	H	Cl	H	495
A-120	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	O-7jll	H	H	Cl	H	419
A-121	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	O-7jll	H	H	H	H	385
A-122	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	F	H	H	425
A-123	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	Me	F	Me	409
A-124	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	F	Me	H	H	395
A-125	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	F	Cl	H	415
A-126	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	CF <sub>3</sub>	H	431
A-127	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	SMe	H	H	Cl	H	409
A-128	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	SO <sub>2</sub> Me	H	H	Cl	H	441
A-129	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	H	NO <sub>2</sub>	H	452
A-130	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	SO <sub>2</sub> Me	H	441
A-131	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	CN	H	388
A-132	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	Cl	Cl	H	431
A-133	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	SO <sub>2</sub> Me	H	H	Br	H	485
A-134	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	H	H	Me	421
A-135	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	H	504
A-136	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	OH	SO <sub>2</sub> Me	H	457
A-137	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	H	SO <sub>2</sub> Me	H	485

化合物No.	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	M+1
A-138	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	SO <sub>2</sub> Me	H	475
A-139	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	SO <sub>2</sub> Me	H	H	CF <sub>3</sub>	H	475
A-140	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	SMe	H	H	F	H	393
A-141	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	Br	Cl	H	441
A-142	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	H	SMe	H	389
A-143	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	SMe	H	H	CF <sub>3</sub>	H	443
A-144	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	SMe	H	Cl	Cl	H	443
A-145	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	SMe	H	409
A-146	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	SMe	H	Br	Cl	H	487
A-147	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	Cl	H	431
A-148	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	SMe	H	OMe	F	H	423
A-149	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	H	OMe	F	H	395
A-150	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	H	SMe	H	453
A-151	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	iPr	H	Br	H	H	449
A-152	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Et	H	H	Br	H	435
A-153	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	SMe	H	H	Br	H	453
A-154	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	OMe	Br	H	515
A-155	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	SO <sub>2</sub> Me	H	F	Cl	H	459
A-156	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	NO <sub>2</sub>	H	H	Me	Me	402
A-157	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	SMe	H	O-CH <sub>2</sub> - CF <sub>2</sub>	Br	H	533

化合物No.	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	M+1
A-158	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	Br	I	H	533
A-159	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	H	SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	F	H	472
A-160	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	NO <sub>2</sub>	Me	Me	402
A-161	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	H	H	SO <sub>2</sub> Me	H	425
A-162	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	F	Cl	H	395
A-163	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	F	CF <sub>3</sub>	H	493
A-164	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	H	H	OCF <sub>3</sub>	491
A-165	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	H	SMe	F	H	411
A-166	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	CHCH <sub>2</sub>	H	H	F	H	373
A-167	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	SMe	H	H	H	H	375
A-168	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	H	SMe	Br	H	471
A-169	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	I	OH	I	597
A-170	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	CN	H	H	H	H	354
A-171	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OMe	H	H	NO <sub>2</sub>	H	404
A-172	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	H	F	415
A-173	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	CF <sub>3</sub>	H	H	H	415
A-174	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	I	H	H	H	473
A-175	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	H	H	F	425
A-176	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	I	H	H	Cl	H	489
A-177	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	I	H	H	H	Me	469
A-178	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	Me	H	H	377

化合物No.	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	M+1
A-179	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	I	H	Me	H	H	469
A-180	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	Me	H	H	421
A-181	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	OMe	OMe	423
A-182	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	Cl	Me	H	H	395
A-183	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	I	H	H	H	Br	533
A-184	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	H	Me	377
A-185	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	H	I	489
A-186	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	H	H	F	361
A-187	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OCHF <sub>2</sub>	H	H	H	H	395
A-188	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	I	H	H	H	Cl	489
A-189	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	I	H	H	OMe	OMe	515
A-190	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Br	H	H	F	H	425
A-191	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	H	422
A-192	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	S-CHF <sub>2</sub>	H	H	H	H	411
A-193	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	NH <sub>2</sub>	H	H	358
A-194	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	NH <sub>2</sub>	H	Me	H	H	358
A-195	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	iPr	H	H	H	H	371
A-196	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	397

【 0 0 4 9 】

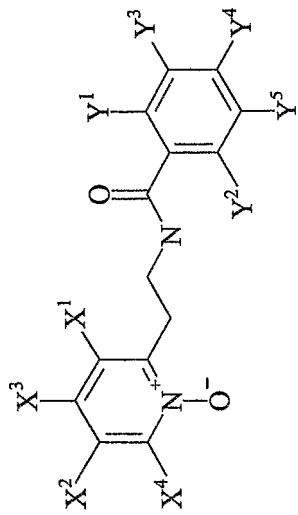
10

20

30



【表 2】



表B

化合物No.	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>5</sup>	M+1
B-1	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	413
B-2	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	OMe	H	H	H	H	375
B-3	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	F	H	HI	HI	381
B-4	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	Me	H	H	H	H	359
B-5	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	F	Cl	H	H	H	398

10

20

30

40

【0050】

(実施例)

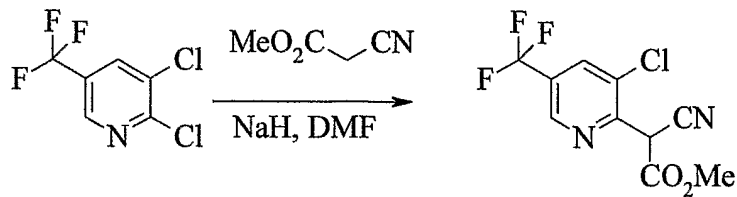
化合物の調製についての以下の実施例は、本発明を例証することを目的として挙げられており、決して、本発明を限定するものと見なされるべきではない。

【0051】

[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジニル](シアノ)酢酸メチルの調製:

【0052】

## 【化19】

手順：

アルゴン下、116 gの水素化ナトリウム（油中の60%分散液；2.91 mol，1.8当量）を3 LのDMFに懸濁させる。得られた懸濁液を、氷冷水浴内で冷却する。攪拌下、160 g（1.616 mol，1.0当量）のシアノ酢酸メチルを200 mLのDMFに溶解させた溶液を滴下して加える。全てのガスの放出が完了したら、攪拌下、350 g（1.616 mol，1.0当量）の2,3-ジクロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジンを添加する。得られた混合物を周囲温度で一晩攪拌する。50 mLのメタノールを添加する。反応媒質を5 Lの水に注ぎ入れる。濃塩酸を用いて、pHを3~4に調節する。形成される[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジニル]（シアノ）酢酸メチルの黄色の沈澱物を濾過し、水で洗浄し、ペンタンで洗浄する。

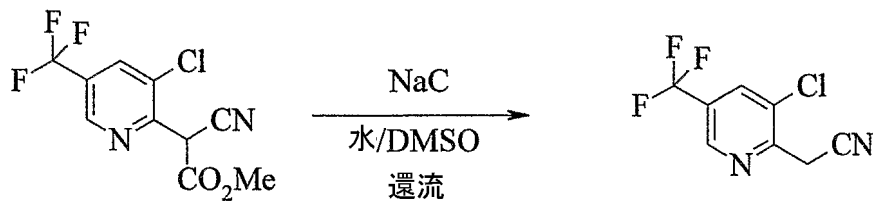
## 【0053】

[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジニル]アセトニトリルの調製

:

## 【0054】

## 【化20】

手順：

44 mLの水と1.1 Lのジメチルスルホキシドの溶液に、314 g（1.13 mol，1当量）の[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジニル]-(シアノ)酢酸メチル及び22 g（0.38 mol，0.33当量）の塩化ナトリウムを溶解させる。反応媒質を攪拌し、160℃で加熱する。全てのガスの放出が完了したら、反応媒質を周囲温度まで冷却する。1 Lの水及び0.5 Lのジクロロメタンを添加する。分離後、水相を0.5 Lのジクロロメタンで2回抽出する。有機相を0.5 Lの水で2回洗浄し、硫酸マグネシウムで脱水する。濃縮した後、粗生成物を100 mLのジクロロメタンで希釈し、シリカ床上で酢酸エチル/ヘプタン混合物（20/80）により溶離させる。濾液を濃縮して、[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジニル]アセトニトリルを得る。

## 【0055】

2-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジニル]エタンアミン酢酸塩の調製

## 【0056】

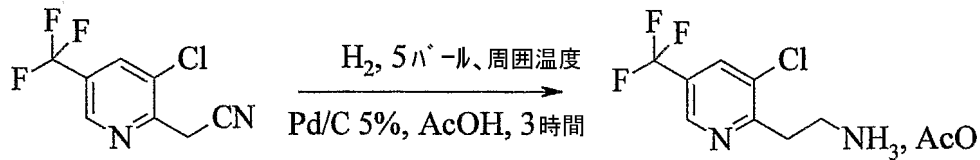
10

20

30

40

## 【化21】

手順：

113 gの[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジニル]アセトニトリル(0.51 mol, 1当量)を、2.5 Lの酢酸で希釈する。30 gのパラジウム(炭担持5%)を添加する。5バールの水素圧下、反応媒質を周囲温度で攪拌する。反応の進行をTLCにより追跡し、[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジニル]アセトニトリルが完全に消費された時点で、反応媒質をセライト床で濾過し、次いで、濃縮乾固して、2-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジニル]エタンアミン酢酸塩を得る。

10

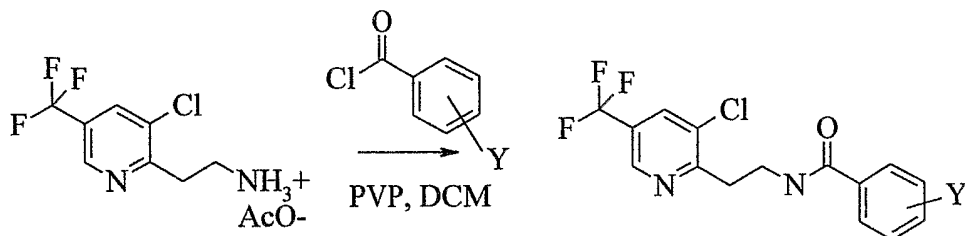
## 【0057】

N-{2-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジニル]エチル}-  
ベンズアミドの調製：

20

## 【0058】

## 【化22】



30

手順：

0.100 gの2-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジニル]エタンアミン酢酸塩(0.00037 mol, 1.0当量)を3 mLのジクロロメタンで希釈する。0.500 gのポリ(4-ビニルピリジン)を添加する。この混合物を周囲温度で30分間攪拌する。1.2当量の所望の塩化アシルを添加する。反応媒質を周囲温度で一晩攪拌し、濾過し、濃縮乾固する。次いで、粗生成物を逆相HPLCで精製する。対応するアミドが得られる。

## 【0059】

一定数の菌類病に対する本発明の一般式(I)の化合物の活性と特許出願WO 01/11965号に記載されている化合物の活性の比較を明確にするために、以下の生物学的活性について試験した。

40

## 【0060】

Alternaria brassicae (アブラナ科の植物の黒斑病(black spot))に対する活性についてのインピボ試験

溶液1又は溶液2の中で磨り潰すことにより、2 g/Lの濃度の被験活性物質の水溶液を調製する。

## 【0061】

溶液1

・ 水

50

- ・ Tween 80 (水で10%に希釈) : 活性物質 1 mg 当たり 5  $\mu$  L
- ・ 活性物質に対して充分な量のクレ- + 100 mg に等しくするためのクレ- ;

溶液 2

慣習的に使用されるアジュバントと界面活性剤を含んでいる濃厚溶液 : 活性物質 1 mg 当たり 200  $\mu$  L。

【0062】

上記水溶液を水で希釈して、所望の濃度とする。

【0063】

ハツカダイコン (品種 Pernot) を、50 / 50 のポゾラン / ピートの底土に播種し、18 ~ 22 に維持する。水性懸濁液を噴霧することにより処理を行う。未処理対照植物には水を噴霧する。処理 24 時間後、12 日間培養したもから得た Alternaria brassicae の孢子 (40000 孢子 / mL) の溶液を噴霧することにより該植物に接種する。

10

【0064】

次いで、ハツカダイコン植物を湿潤雰囲気内で 18 ~ 20 に維持する。7 ~ 8 日間インキュベーションした後、上記生成物の効力を対照植物と比較して評価する。

【0065】

キュウリの Botrytis cinerea に対する活性についてのインビボ試験

溶液 1 又は溶液 2 の中で磨り潰すことにより、2 g / L の濃度の被験活性物質の水溶液を調製する。

20

【0066】

溶液 1

- ・ 水
- ・ Tween 80 (水で10%に希釈) : 活性物質 1 mg 当たり 5  $\mu$  L
- ・ 活性物質に対して充分な量のクレ- + 100 mg に等しくするためのクレ- ;

溶液 2

慣習的に使用されるアジュバントと界面活性剤を含んでいる濃厚溶液 : 活性物質 1 mg 当たり 200  $\mu$  L。

【0067】

上記水溶液を水で希釈して、所望の濃度とする。

30

【0068】

キュウリ (品種 Marketer) を、50 / 50 のポゾラン / ピートの底土に播種し、18 ~ 22 に維持する。水性懸濁液を噴霧することにより処理を行う。未処理対照植物には水を噴霧する。

【0069】

処理 24 時間後、15 日間培養したもから得た Botrytis cinerea の孢子 (150000 孢子 / mL) の溶液を噴霧することにより該植物に接種する。

【0070】

次いで、キュウリ植物を湿潤雰囲気内で 11 ~ 15 に維持する。7 ~ 8 日間インキュベーションした後、上記生成物の効力を対照植物と比較して評価する。

40

【0071】

Pyrenophora teres (オオムギの網斑病) に対する活性についてのインビボ試験

溶液 1 又は溶液 2 の中で磨り潰すことにより、2 g / L の濃度の被験活性物質の水溶液を調製する。

【0072】

溶液 1

- ・ 水
- ・ Tween 80 (水で10%に希釈) : 活性物質 1 mg 当たり 5  $\mu$  L
- ・ 活性物質に対して充分な量のクレ- + 100 mg に等しくするためのクレ- ;

50

溶液 2

慣習的に使用されるアジュバントと界面活性剤を含んでいる濃厚溶液：活性物質 1 mg 当たり 200  $\mu$ L。

【0073】

上記水溶液を水で希釈して、所望の濃度とする。

【0074】

オオムギ植物（品種 *Express*）を、50/50のポズラン/ピートの底土に播種し、12 に維持する。水性懸濁液を噴霧することにより、1葉期（10 cm）で処理を行う。未処理対照植物には水を噴霧する。

【0075】

処理24時間後、10日間培養したものから得た *Pyrenophora teres* の孢子（10000孢子/mL）の溶液を噴霧することにより該植物に接種する。

【0076】

次いで、オオムギ植物を湿潤雰囲気内で18 に維持する。8~15日間インキュベーションした後、上記生成物の効力を対照植物と比較して評価する。

【0077】

*Septoria tritici*（コムギのセプトリア病）に対する活性についてのインビボ試験

溶液1又は溶液2の中で磨り潰すことにより、2 g/Lの濃度の被験活性物質の水溶液を調製する。

【0078】

溶液 1

- ・ 水
- ・ Tween 80（水で10%に希釈）：活性物質 1 mg 当たり 5  $\mu$ L
- ・ 活性物質に対して十分な量のクレ- + 100 mg に等しくするためのクレ-；

溶液 2

慣習的に使用されるアジュバントと界面活性剤を含んでいる濃厚溶液：活性物質 1 mg 当たり 200  $\mu$ L。

【0079】

上記水溶液を水で希釈して、所望の濃度とする。

【0080】

コムギ植物（品種 *Scipion*）を、50/50のポズラン/ピートの底土に播種し、12 に維持する。水性懸濁液を噴霧することにより、1葉期（10 cm）で処理を行う。未処理対照植物には水を噴霧する。

【0081】

処理24時間後、7日間培養したものから得た *Septoria tritici* の孢子（50000孢子/mL）の溶液を噴霧することにより該植物に接種する。

【0082】

次いで、コムギ植物を湿潤雰囲気内で18~20 に72時間維持した後、90%の相対湿度に維持する。汚染してから21~28日間後、上記生成物の効力を対照植物と比較して評価する。

【0083】

該分子の効力について、未処理植物に対する相対的な防除%により、500 g/ha、250 g/ha、又は、330 ppmで評価する。このような条件下、優れた効力は、80%を超える効力として定義する。平均的な効力は、50~80%の効力として定義する。不十分な効力は、10~50%の効力として定義する。無効力は、10%未満の効力として定義する。

【0084】

500 g/haの濃度で、以下の化合物は、下記菌類病原体に対して、優れた効力~平均的な効力を示した：

10

20

30

40

50

Alternaria brassicae: A - 2、A - 4、A - 6、A - 7、A - 9、A - 13、A - 14、A - 20、A - 25;

Botrytis cinerea: A - 2、A - 7、A - 9、A - 20、A - 25;

Pyrenophora teres: A - 2、A - 4、A - 5、A - 6、A - 7、A - 9、A - 20、A - 25、A - 27;

Septoria tritici: A - 2、A - 4、A - 5、A - 6、A - 7、A - 16、A - 18、A - 20、A - 21、A - 22、A - 23、A - 24、A - 25。

【0085】

250g/haの濃度で、以下の化合物は、下記菌類病原体に対して、優れた効力～平均的な効力を示した:

Alternaria brassicae: A - 20、A - 28、A - 29、A - 41、A - 45、A - 46、A - 73、A - 173;

Botrytis cinerea: A - 20、A - 45、A - 46、A - 73;

Pyrenophora teres: A - 20、A - 45、A - 46、A - 73。

【0086】

330ppmの濃度で、以下の化合物は、下記菌類病原体に対して、優れた効力～平均的な効力を示した:

Alternaria brassicae: A - 20、A - 44、A - 45、A - 46、A - 47、A - 48、A - 49、A - 52、A - 60、A - 61、A - 62、A - 71、A - 72、A - 73、A - 74、A - 75、A - 76、A - 77、A - 79、A - 80、A - 83、A - 84、A - 85、A - 86、A - 87、A - 89、A - 91、A - 92、A - 96、A - 98、A - 99、A - 100、A - 107、A - 110、A - 112、A - 113、A - 117、A - 122、A - 123、A - 124、A - 125、A - 127、A - 128、A - 133、A - 134、A - 135、A - 136、A - 137、A - 138、A - 139、A - 140、A - 141、A - 142、A - 143、A - 144、A - 146、A - 147、A - 148、A - 150、A - 151、A - 152、A - 156、A - 157、A - 158、A - 159、A - 162、A - 165、A - 166、A - 167、A - 168、A - 169、A - 170、A - 171、A - 173、A - 174、A - 175、A - 176、A - 177、A - 178、A - 179、A - 180、A - 181、A - 182、A - 183、A - 184、A - 185、A - 186、A - 187、A - 188、A - 189、A - 194、B - 1;

Botrytis cinerea: A - 20、A - 45、A - 46、A - 73、A - 170、A - 172、A - 173、A - 174、A - 175、A - 187;

Pyrenophora teres: A - 20、A - 44、A - 45、A - 46、A - 61、A - 73、A - 83、A - 87、A - 89、A - 96、A - 117、A - 125、A - 133、A - 134、A - 140、A - 167、A - 173、A - 174、A - 187、B - 1。

【0087】

このような条件下、N - { 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, 6 - ジクロロベンズアミドは、Alternaria Brassicaeに対しては、330ppm及び250g/haで、それぞれ、不十分な効力及び無効力を示し、Botrytis cinereaに対しては、250g/ha及び330ppmで、無効力を示した。

【0088】

このような条件下、特許出願WO01/11965号に開示されている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中の化合物316を参照されたい)は、250g/haで、Alternaria Brassicae及びSeptoria triticiに対しては、不十分な効力を示し、Botrytis cinereaに対しては、無効力を示した。同様に、特許出願WO01/11965号に開示されているN - {

10

20

30

40

50

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中の化合物307を参照されたい) は、250g/haで、Alternaria Brassicae 及び Botrytis cinerea に対して無効力を示した。同様に、特許出願WO01/11965号に開示されている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 - { 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中の化合物304及び化合物314を参照されたい) は、250g/haで、Septoria tritici に対しては不十分な効力を示し、Botrytis cinerea に対しては無効力を示した。また、同様に、特許出願WO01/11965号に開示されている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中の化合物306、化合物310及び化合物315を参照されたい) は、250g/haで、Botrytis cinerea に対して無効力を示した。

## フロントページの続き

- (72)発明者 マンスフィールド, ダレン・ジエイムズ  
フランス国、エフ - 6 9 0 0 4 ・リヨン、モンテ・ボナフ、2 5
- (72)発明者 クック, トレイシー  
イギリス国、セント・オーバンズ・エイ・エル・2・3・エヌ・エヌ、ブリケット・ウッド、ラーチ・アベニュー・7
- (72)発明者 トーマス, ピーター・スタンリー  
イギリス国、ケンブリッジシャー・シー・ビー・1・6・エル・ダブリュ、ケンブリッジ、リントン、ボルシヤム・ロード・9 4
- (72)発明者 コケロン, ピエール・イブ  
フランス国、エフ - 6 9 0 0 6 ・リヨン、リュ・ドウ・ラ・テット・ドール、3 6
- (72)発明者 ボール, ジャン・ピエール  
フランス国、エフ - 6 9 0 0 9 ・リヨン、シユマン・ドウ・モンペラ、1 6
- (72)発明者 ブリッグス, ジェフリー・ゴウワー  
イギリス国、ハートフォードシャー・エイ・エル・5・5・キュー・アール、ハーツ、ハーペンデン、グランビイ・アベニュー、4 6
- (72)発明者 ラシエーズ, エレーヌ  
フランス国、エフ - 6 9 0 0 9 ・リヨン、シユマン・ドウ・モンペラ・1 1
- (72)発明者 リーク, ハイコー  
フランス国、6 9 1 1 0 ・サント・フオア・レ・リヨン、リュ・クロード・モネ、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 グロジャン - クールノワイエ, マリー - クレール  
フランス国、エフ - 6 9 2 5 0 ・キュリ・オー・モン・ドール、ルート・ダルビニー、ル・トレーブ・コロージュ

審査官 瀬下 浩一

- (56)参考文献 国際公開第 0 1 / 0 1 1 9 6 5 ( WO , A 1 )  
米国特許第 0 2 8 7 0 1 4 6 ( US , A )  
米国特許第 0 2 8 9 9 4 3 7 ( US , A )  
SAM, J. , New compounds. Amides derived from 2-(2-pyridyl)ethylamines , Journal of Pharmaceutical Sciences , 1 9 6 7 年 , Vol.56, No.9 , p.1202-5  
SHAPIRO, S.L. et al , Pyridylethylated benzoxazinediones , Journal of the American Chemical Society , 1 9 5 7 年 , Vol.79 , p.2811-14

- (58)調査した分野(Int.Cl. , D B 名)  
C07D 213/61  
A01N 25/30  
A01N 43/40  
A01P 3/00  
CAplus/REGISTRY(STN)