

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2013-49692

(P2013-49692A)

(43) 公開日 平成25年3月14日(2013.3.14)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
<b>CO7D 333/38</b> (2006.01)	CO7D 333/38	CSP 4C023
<b>AO1N 43/10</b> (2006.01)	AO1N 43/10	F 4C063
<b>AO1N 43/56</b> (2006.01)	AO1N 43/56	C 4H011
<b>AO1N 43/78</b> (2006.01)	AO1N 43/78	B 4H039
<b>AO1P 3/00</b> (2006.01)	AO1P 3/00	

審査請求 有 請求項の数 8 OL 外国語出願 (全 58 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2012-235704 (P2012-235704)  
 (22) 出願日 平成24年10月25日 (2012.10.25)  
 (62) 分割の表示 特願2008-504767 (P2008-504767) の分割  
 原出願日 平成18年4月6日 (2006.4.6)  
 (31) 優先権主張番号 05356063.7  
 (32) 優先日 平成17年4月8日 (2005.4.8)  
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)

(71) 出願人 507203353  
 バイエル・クroppサイエンス・アーゲー  
 BAYER CROPPSCIENCE A  
 G  
 ドイツ国、40789・モンハイム、アル  
 フレートーノベルーシユトラーセ・50  
 (74) 代理人 110001173  
 特許業務法人川口国際特許事務所  
 (72) 発明者 ダレン・マンスフィールド  
 ドイツ国、51429・ベルギシュ・グラ  
 ートバハ、グラフーアドルフ・シユトラ  
 ーセ・7

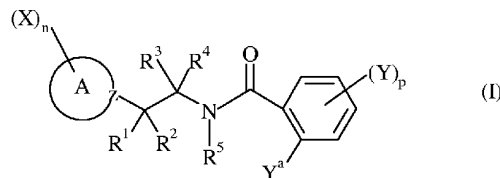
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 新規ヘテロシクリルエチルカルボキサミド誘導体

(57) 【要約】 (修正有)

【課題】 農薬用殺菌剤として有用な新規ヘテロシクリルエチルカルボキサミド誘導体、及び該誘導体を含有する殺菌剤組成物の提供。

【解決手段】 一般式 (I) で表されるヘテロシクリルエチルカルボキサミド誘導体、及び該誘導体を含有する殺菌剤組成物。



[ 式中、n は、1 又は 2 であり、A は、2 - チオフェン又は 4 - ピラゾールであり、z は、炭素原子であり、X は、メチル基、ハロゲン原子、ハロゲノアルキルであり、R<sup>1</sup> ~ R<sup>5</sup> は、水素原子であり、Het は、同一であっても又は異なってもよい 1 個又は 2 個のヘテロ原子を有する 5 員のヘテロ環であって、2 - フラン、3 - フラン、2 - チオフェン、3 - チオフェン、2 - ピロール、3 - ピロール、5 - チアゾール、4 - チアゾール、5 - ピラゾール、4 - ピラゾール、3 - ピラゾールを表わす。 ]

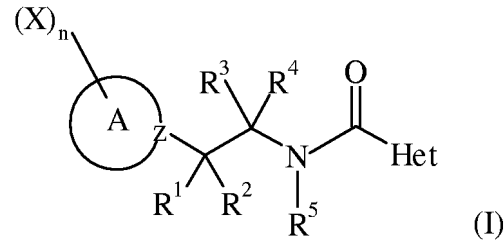
【選択図】 なし

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

一般式 (I)

## 【化 1】



10

[ 式中、

- ・ n は、1、2、3 又は 4 であり；
- ・ A は、同一であっても又は異なってもよい 1 個、2 個又は 3 個のヘテロ原子を有する 5 員非縮合ヘテロ環を表し；但し、A は、2 - ピロリル、4 - イソオキサゾリル、4 - イミダゾリル及び 1 - イミダゾリルとは異なっており；
- ・ Z は、炭素原子又はヘテロ原子（ここで、これには、X は置換することができない）であり；
- ・ X は、同一であるか又は異なっていて、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、ヒドロキシ基、アミノ基、スルファニル基、ペンタフルオロ - ?<sup>6</sup> - スルファニル基、ホルミル基、ホルミルオキシ基、ホルミルアミノ基、カルボキシ基、カルバモイル基、N - ヒドロキシカルバモイル基、カルバメート基、（ヒドロキシイミノ） - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル基、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> - アルキニル、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキルアミノ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルキル、ジ - C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキルアミノ、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルコキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキルスルファニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルキルスルファニル、C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> - アルケニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルケニルオキシ、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - アルキニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルキニルオキシ、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノシクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキルカルボニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキルカルバモイル、ジ - C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキルカルバモイル、N - C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキルオキシカルバモイル、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルコキシカルバモイル、N - C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキル - C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルコキシカルバモイル、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルコキシカルボニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキルカルボニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルキルカルボニルオキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキルカルボニルアミノ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルキルカルボニルアミノ、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキルアミノカルボニルオキシ、ジ - C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキルアミノカルボニルオキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキルオキシカルボニルオキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキルスルフェニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルキルスルフェニル、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキルスルフィニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキルスルホニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシイミノ、（C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシイミノ） - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、（C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルオキシイミノ） - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル又は（C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニルオキシイミノ） - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルであり；
- ・ R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> は、同一であるか又は異なっていて、水素原子、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> - アルキニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノシクロアルキル又は 1 ~ 5 個のハ

50

ロゲン原子を有する  $C_1 - C_8$  - ハロゲノアルキルであり；

・  $R^3$  及び  $R^4$  は、同一であるか又は異なっていて、水素原子、 $C_1 - C_8$  - アルキル、 $C_2 - C_8$  - アルケニル、 $C_2 - C_8$  - アルキニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_3 - C_8$  - ハロゲノシクロアルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_8$  - ハロゲノアルキルであり；

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

・  $Het$  は、同一であっても又は異なっていてよい 1 個、2 個又は 3 個のヘテロ原子を有する 5 員、6 員又は 7 員のヘテロ環を表し、ここで、 $Het$  は、炭素原子で結合しており、また、 $Het$  は、少なくともオルト位が置換されており、その際、置換基は、互いに独立して、ハロゲン原子、ペンタフルオロ - ?<sup>6</sup> - スルファニル基、 $C_1 - C_8$  - アルキル、 $C_2 - C_8$  - アルケニル、 $C_2 - C_8$  - アルキニル、1 ~ 5 個のフッ素原子を有する  $C_1 - C_8$  - フルオロアルキル、 $C_1 - C_8$  - アルコキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_8$  - ハロゲノアルコキシ、 $C_2 - C_8$  - アルケニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_2 - C_8$  - ハロゲノアルケニルオキシ、 $C_3 - C_8$  - アルキニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_3 - C_8$  - ハロゲノアルキニルオキシ、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_3 - C_8$  - ハロゲノシクロアルキルであるように選択される]

で表される化合物、並びに、その塩、N - オキシド、金属錯体、半金属錯体及び光学活性異性体。

【請求項 2】

$n$  が、1 又は 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】

$X$  が、水素原子、メチル基、ハロゲン原子又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_8$  - ハロゲノアルキルであるように選択されることを特徴とする、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

$R^1$  及び  $R^2$  が、互いに独立して、水素原子、 $C_1 - C_8$  - アルキル、 $C_2 - C_8$  - アルケニル、 $C_2 - C_8$  - アルキニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_3 - C_8$  - ハロゲノシクロアルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_8$  - ハロゲノアルキルであるように選択されることを特徴とする、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 5】

$R^3$  及び  $R^4$  が、互いに独立して、水素原子、 $C_1 - C_8$  - アルキル、 $C_2 - C_8$  - アルケニル、 $C_2 - C_8$  - アルキニル、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_3 - C_8$  - ハロゲノシクロアルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_8$  - ハロゲノアルキルであるように選択されることを特徴とする、請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 6】

$Het$  が芳香族ヘテロ環であることを特徴とする、請求項 1 ~ 6 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 7】

$Het$  が 6 員環式ヘテロ環であることを特徴とする、請求項 1 ~ 6 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 8】

$Het$  が 5 員環式ヘテロ環であることを特徴とする、請求項 1 ~ 6 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 9】

$Het$  が、2 - フラン、3 - フラン、2 - チオフェン、3 - チオフェン、2 - ピロール、3 - ピロール、5 - オキサゾール、4 - オキサゾール、5 - チアゾール、4 - チアゾー

10

20

30

40

50

ル、5 - ピラゾール、4 - ピラゾール、3 - ピラゾール、3 - イソオキサゾール、4 - イソオキサゾール、5 - イソオキサゾール、3 - イソチアゾール、4 - 1, 2, 3 - トリアゾール、4 - チアジアゾール、5 - チアジアゾール、2 - ピリジン、3 - ピリジン、4 - ピリジン又は2 - ピラジンであるように選択されることを特徴とする、請求項1～5のいずれかに記載の化合物。

【請求項10】

Aが芳香族ヘテロ環であることを特徴とする、請求項1～9のいずれかに記載の化合物。

【請求項11】

Aが、2 - チオフェン又は4 - ピラゾールであるように選択されることを特徴とする、請求項1～10のいずれかに記載の化合物。

10

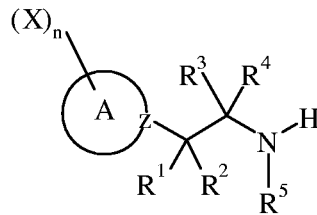
【請求項12】

Aがオルト位で置換されていることを特徴とする、請求項1～11のいずれかに記載の化合物。

【請求項13】

請求項1で定義されている一般式(I)で表される化合物を調製する方法であって、一般式(II)

【化2】



20

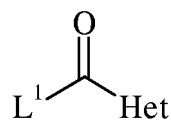
(II)

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

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

30

【化3】



(III)

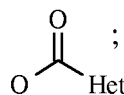
[式中、

・ Hetは、請求項1で定義されているとおりであり；

・ L<sup>1</sup>は、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、-OR<sup>1 2 4</sup>又は-OCOR<sup>1 2 4</sup>であるように選択される脱離基であり、ここで、R<sup>1 2 4</sup>は、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、ベンジル、4-メトキシベンジル、ペンタフルオロフェニル又は式

40

【化4】



で表される基である]

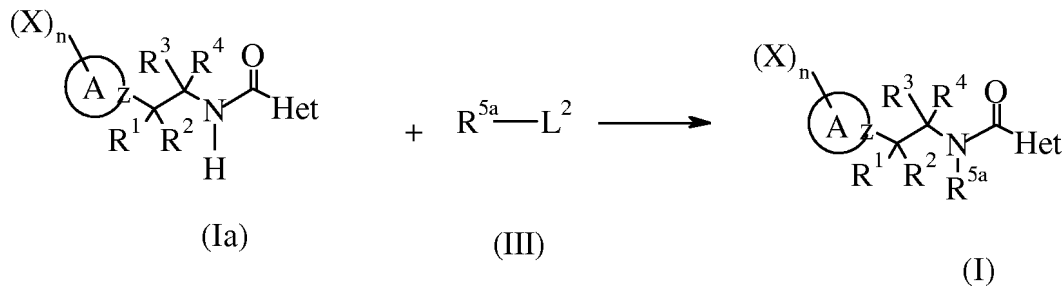
で表されるカルボン酸誘導体と、触媒の存在下で、また、L<sup>1</sup>がヒドロキシル基である場合は、縮合剤の存在下で、反応させることを含む、前記方法。

50

## 【請求項 1 4】

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

## 【化 5】



10

[ここで、

- ・ A、X、n、z、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> 及び Het は、請求項 1 で定義されているとおりであり；

- ・ R<sup>5a</sup> は、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル又は C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub> - シクロアルキルであり；

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

に従うさらなるステップにより完結されることを特徴とする、請求項 1 3 に記載の方法。

20

## 【請求項 1 5】

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

## 【請求項 1 6】

作物の植物病原性菌類と予防的又は治療的に闘う方法であって、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 に記載の組成物を、植物の種子、又は、植物の葉及び/若しくは植物の果実、又は、植物がそこで生育している土壌若しくは植物をそこで栽培するのが望ましい土壌に施用することを特徴とする、前記方法。

## 【発明の詳細な説明】

## 【技術分野】

30

## 【0001】

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

## 【背景技術】

## 【0002】

国際特許出願 WO 2004/074280 には、2 - ピリジルエチルカルボキサミド誘導体の大きなファミリー及びそれらの殺菌剤としての使用が開示されている。この文献は、それが本発明のヘテロシクリルエチルベンズアミド誘導体を包含するという点については全く開示していない。

40

## 【先行技術文献】

## 【特許文献】

## 【0003】

【特許文献 1】国際公開第 2004/074280 号

## 【発明の概要】

## 【発明が解決しようとする課題】

## 【0004】

当業者に既に知られている化合物よりも活性が高い農薬活性化合物を使用し、それによって、これまでと同じ効力を維持しながら、より少ない化合物を使用することを可能とす

50

ることに関して、農薬分野においては常に高い関心が持たれている。

【0005】

さらに、より高い効力を有する新規農薬活性化合物を提供することにより、処理対象の菌類における耐性株の出現のリスクが大きく低減される。

【課題を解決するための手段】

【0006】

本発明者らは、上記特徴を有する化合物の新規ファミリーを見いだした。

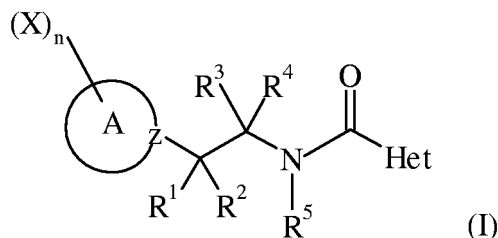
【0007】

従って、本発明は、一般式(I)

【0008】

10

【化1】



[式中、

20

・ nは、1、2、3又は4であり；

・ Aは、同一であっても又は異なってもよい1個、2個又は3個のヘテロ原子を有する5員非縮合ヘテロ環を表し；但し、Aは、2-ピロリル、4-イソオキサゾリル、4-イミダゾリル及び1-イミダゾリルとは異なっており；

・ Zは、炭素原子又はヘテロ原子（ここで、これには、Xは置換することができない）であり；

・ Xは、同一であるか又は異なっていて、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、ヒドロキシ基、アミノ基、スルファニル基、ペンタフルオロ-<sup>6</sup>-スルファニル基、ホルミル基、ホルミルオキシ基、ホルミルアミノ基、カルボキシ基、カルバモイル基、N-ヒドロキシカルバモイル基、カルバメート基、（ヒドロキシイミノ）-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-アルキニル、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキルアミノ、1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-ハロゲノアルキル、ジ-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキルアミノ、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルコキシ、1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-ハロゲノアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキルスルファニル、1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-ハロゲノアルキルスルファニル、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-アルケニルオキシ、1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-ハロゲノアルケニルオキシ、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-アルキニルオキシ、1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-ハロゲノアルキニルオキシ、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-ハロゲノシクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキルカルボニル、1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-ハロゲノアルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキルカルバモイル、ジ-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキルカルバモイル、N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキルオキシカルバモイル、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルコキシカルバモイル、N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキル-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルコキシカルバモイル、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルコキシカルボニル、1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-ハロゲノアルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキルカルボニルオキシ、1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-ハロゲノアルキルカルボニルオキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキルカルボニルアミノ、1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-ハロゲノアルキルカルボニルアミノ、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキルアミノカルボニルオキシ、ジ-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキルアミノカルボニルオキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキルオキシカルボニルオキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキルスルフェニル、1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-ハロゲノアルキルスルフェニル、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキルスルフィニル、1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-ハロゲノアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-

30

40

50

C<sub>8</sub> - アルキルスルホニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシミノ) - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルオキシミノ) - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル又は (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニルオキシミノ) - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルであり；

- ・ R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> は、同一であるか又は異なっていて、水素原子、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> - アルキニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノシクロアルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルキルであり；

- ・ R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> は、同一であるか又は異なっていて、水素原子、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> - アルキニル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノシクロアルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルキルであり；

- ・ R<sup>5</sup> は、水素原子、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル又は C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub> - シクロアルキルであり；

- ・ H e t は、同一であっても又は異なっていてよい 1 個、2 個又は 3 個のヘテロ原子を有する 5 員、6 員又は 7 員のヘテロ環を表し、ここで、H e t は、炭素原子で結合しており、また、H e t は、少なくともオルト位が置換されており、その際、置換基は、互いに独立して、ハロゲン原子、ペンタフルオロ - ?<sup>6</sup> - スルファニル基、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> - アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> - アルキニル、1 ~ 5 個のフッ素原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - フルオロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルコキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルコキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> - アルケニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルケニルオキシ、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - アルキニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルキニルオキシ、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - シクロアルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノシクロアルキルであるように選択される ]

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

【発明を実施するための形態】

【0009】

本発明に関連して：

- ・ ハロゲンは、フッ素、臭素、塩素又はヨウ素を意味する；
- ・ カルボキシは、-C(=O)OH を意味し、カルボニルは、-C(=O)- を意味し、カルバモイルは、-C(=O)NH<sub>2</sub> を意味し、N - ヒドロキシカルバモイルは、-C(=O)NHOH を意味する；
- ・ アルキル基、アルケニル基及びアルキニル基、並びに、これらの用語を含んでいる部分構造は、直鎖又は分枝鎖であることができる；
- ・ ヘテロ原子は、硫黄、窒素又は酸素を意味する。

【0010】

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

【0011】

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

【0012】

10

20

30

40

50

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

【0013】

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

10

【0014】

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

- ・ nに関しては、nは、1又は2である；
- ・ Xに関しては、Xは、メチル基、ハロゲン原子又は1～5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-ハロゲノアルキルであるように選択され、さらに好ましくは、Xは、ハロゲン原子である。

20

【0015】

本発明では、式(I)の化合物のカルボキサミド部分の炭素原子は、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>で置換されており、ここで、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は上記で定義されているとおりである。好ましくは、本発明は、一般式(I)で表されるヘテロシクリルエチルカルボキサミド誘導体にも関し、ここで、種々の特性は、下記のものとして、単独で選択され得るか又は組み合わせて選択され得る：

- ・ R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>に関しては、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、互いに独立して、水素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-アルキニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、1～5個のハロゲン原子を有するC<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-ハロゲノシクロアルキル又は1～5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-ハロゲノアルキルであるように選択される；
- ・ R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>に関しては、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、互いに独立して、水素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-アルキニル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル、1～5個のハロゲン原子を有するC<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-ハロゲノシクロアルキル又は1～5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-ハロゲノアルキルであるように選択される。

30

【0016】

本発明では、式(I)の化合物のカルボキサミド部分の窒素原子は、R<sup>5</sup>で置換されており、ここで、R<sup>5</sup>は、水素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル又はC<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-シクロアルキルであり、好ましくは、該C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-シクロアルキルは、シクロプロピルである。

【0017】

本発明では、一般式(I)の化合物の「Het」は、同一であっても又は異なってもよい1個、2個又は3個のヘテロ原子を有する5員、6員又は7員(non-condensed)ヘテロ環であり、ここで、Hetは、炭素原子で結合しており、また、Hetは、少なくともオルト位が置換されている。好ましくは、本発明は、一般式(I)で表されるヘテロシクリルエチルカルボキサミド誘導体にも関し、ここで、Hetは、同一であっても又は異なってもよい1個、2個又は3個のヘテロ原子を有する5員、6員又は7員(aromatic)芳香族非縮合ヘテロ環である。さらに好ましくは、Hetは、2-フラン、3-フラン、2-チオフェン、3-チオフェン、2-ピロール、3-ピロール、5-オキサゾール、4-オキサゾール、5-チアゾール、4-チアゾール、5-ピラゾール、4-ピラゾール、3-ピラゾール、3-イソオキサゾール、4-イソオキサゾール、5-イソオキサゾール、3-イソチア

40

50



ゾール、4 - 1, 2, 3 - トリアゾール、4 - チアジアゾール、5 - チアジアゾール、2 - ピリジン、3 - ピリジン、4 - ピリジン又は2 - ピラジンであるように選択される。

【0018】

本発明では、一般式(I)で表される化合物の「Het」は、5員環式ヘテロ環であることができる。Hetが5員ヘテロ環である本発明化合物の特定例としては、以下のものを挙げることができる。

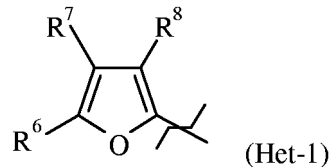
【0019】

\* Hetは、一般式(Het-1)

【0020】

【化2】

10



[式中、

・ R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、アミノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル又は1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキルであり得る；

20

及び、

・ R<sup>8</sup>は、ハロゲン原子、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル又は1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキルであり得る]

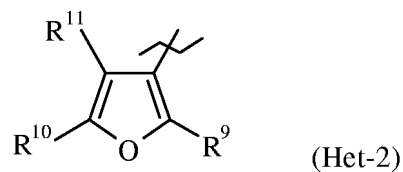
のヘテロ環を表す。

【0021】

\* Hetは、一般式(Het-2)

【0022】

【化3】



30

[式中、

・ R<sup>9</sup>は、水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル又は1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキルであり得る；

及び、

・ R<sup>10</sup>及びR<sup>11</sup>は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル又は1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキルであり得る；

40

但し、R<sup>9</sup>とR<sup>11</sup>が両方とも水素原子であることはない]

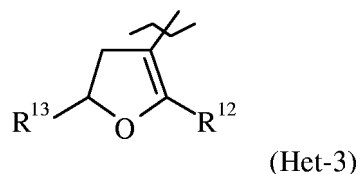
のヘテロ環を表す。

【0023】

\* Hetは、一般式(Het-3)

【0024】

## 【化4】



[ 式中、

・ R<sup>12</sup> は、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る；

及び、

・ R<sup>13</sup> は、水素原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る ]

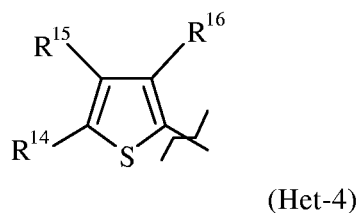
のヘテロ環を表す。

【0025】

\* Het は、一般式 (Het - 4)

【0026】

【化5】



[ 式中、

・ R<sup>14</sup> 及び R<sup>15</sup> は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルチオ又は C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルスルホニルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルで場合により置換されていてもよいピリジルであり得る；

及び、

・ R<sup>16</sup> は、ハロゲン原子、シアノ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルコキシであり得る ]

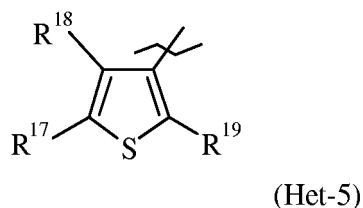
のヘテロ環を表す。

【0027】

\* Het は、一般式 (Het - 5)

【0028】

【化6】



[ 式中、

・ R<sup>17</sup> 及び R<sup>18</sup> は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルオキシ又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る；

50

及び、

・  $R^{19}$  は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_4$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルであり得る；

但し、 $R^{18}$  と  $R^{19}$  が両方とも水素原子であることはない]

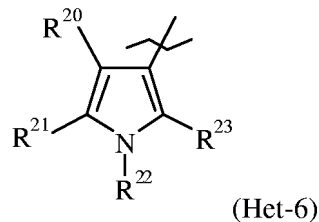
のヘテロ環を表す。

【0029】

\* Het は、一般式 (Het-6)

【0030】

【化7】



10

[ 式中、

・  $R^{20}$  は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 - C_4$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルであり得る；

・  $R^{21}$  及び  $R^{23}$  は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_4$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルであり得る；

20

及び、

・  $R^{22}$  は、水素原子、シアノ基、 $C_1 - C_4$  - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、ヒドロキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルスルホニル、ジ ( $C_1 - C_4$  - アルキル) アミノスルホニル又は  $C_1 - C_6$  - アルキルカルボニルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは  $C_1 - C_4$  - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルスルホニルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは  $C_1 - C_4$  - アルキルで場合により置換されていてもよいベンゾイルであり得る；

30

但し、 $R^{20}$  と  $R^{23}$  が両方とも水素原子であることはない]

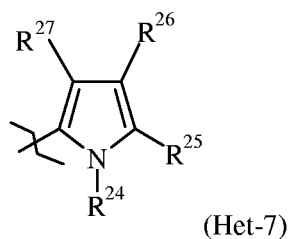
のヘテロ環を表す。

【0031】

\* Het は、一般式 (Het-7)

【0032】

【化8】



40

[ 式中、

・  $R^{24}$  は、水素原子、シアノ基、 $C_1 - C_4$  - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、ヒドロキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルスルホニル、ジ ( $C_1 - C_4$  - アルキル) アミノスルホニル又は  $C_1 - C_6$  - アルキルカルボニルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは  $C_1 - C_4$  - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルスルホニルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは  $C_1 - C_4$  - アルキルで場

50

合により置換されていてもよいベンゾイルであり得る；  
及び、

・  $R^{25}$ 、 $R^{26}$  及び  $R^{27}$  は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 - C_4$  - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキル又は  $C_1 - C_4$  - アルキルカルボニルであり得る；

但し、 $R^{24}$  と  $R^{27}$  が両方とも水素原子であることはない]

のヘテロ環を表す。

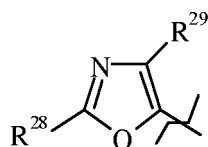
【0033】

\* Het は、一般式 (Het-8)

10

【0034】

【化9】



(Het-8)

[式中、

・  $R^{28}$  は、水素原子又は  $C_1 - C_4$  - アルキルであり得る；

20

及び、

・  $R^{29}$  は、ハロゲン原子、 $C_1 - C_4$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルであり得る]

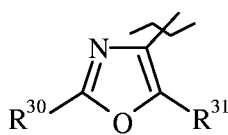
のヘテロ環を表す。

【0035】

\* Het は、一般式 (Het-9)

【0036】

【化10】



(Het-9)

30

[式中、

・  $R^{30}$  は、水素原子又は  $C_1 - C_4$  - アルキルであり得る；

及び、

・  $R^{31}$  は、ハロゲン原子、 $C_1 - C_4$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは  $C_1 - C_4$  - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルであり得る]

40

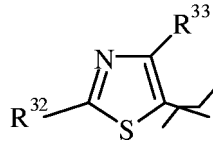
のヘテロ環を表す。

【0037】

\* Het は、一般式 (Het-10)

【0038】

## 【化 1 1】



(Het-10)

[ 式中、

・ R<sup>32</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、アミノ基、シアノ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルアミノ、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル) アミノ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルであり得る；及び、

・ R<sup>33</sup> は、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る ]  
のヘテロ環を表す。

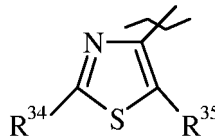
【 0 0 3 9 】

\* Het は、一般式 ( Het - 1 1 )

【 0 0 4 0 】

【化 1 2】

20



(Het-11)

[ 式中、

・ R<sup>34</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、アミノ基、シアノ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルアミノ、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル) アミノ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る；及び、

・ R<sup>35</sup> は、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る ]  
のヘテロ環を表す。

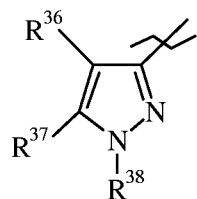
【 0 0 4 1 】

\* Het は、一般式 ( Het - 1 2 )

【 0 0 4 2 】

【化 1 3】

40



(Het-12)

[ 式中、

・ R<sup>36</sup> は、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルチオ、アミノカルボニル基又はアミノカルボニル - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであ

50

り得る；

・  $R^{37}$  は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又は  $C_1 - C_4$  - アルキルチオであり得る；

及び、

・  $R^{38}$  は、水素原子、フェニル、 $C_1 - C_4$  - アルキル、1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキル、ヒドロキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルチオ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルチオ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル又は1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキルであり得る ] のヘテロ環を表す。

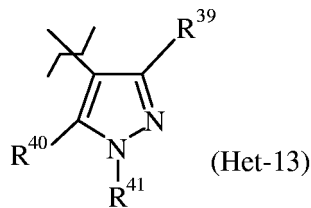
10

【0043】

\* Het は、一般式 (Het-13)

【0044】

【化14】



20

[ 式中、

・  $R^{39}$  は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1 - C_4$  - アルキル、1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキルチオ、1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルチオ、アミノカルボニル又はアミノカルボニル -  $C_1 - C_4$  - アルキルであり得る；

・  $R^{40}$  は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルコキシ又は  $C_1 - C_4$  - アルキルチオであり得る；

30

及び、

・  $R^{41}$  は、水素原子、 $C_1 - C_4$  - アルキル、1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキル、ヒドロキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルチオ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルチオ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル又は1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキルであり得るか、又は、ハロゲン原子、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシアルキル若しくはニトロ基で場合により置換されていてもよいフェニルであり得る；

40

但し、 $R^{39}$  と  $R^{40}$  が両方とも水素原子であることはない ]

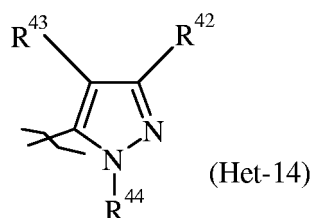
のヘテロ環を表す。

【0045】

\* Het は、一般式 (Het-14)

【0046】

## 【化15】



[式中、

・  $R^{42}$  は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $1 \sim 5$ 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $1 \sim 5$ 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、 $1 \sim 5$ 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルチオ、アミノカルボニル又はアミノカルボニル- $C_1 - C_4$ -アルキルであり得る；

・  $R^{43}$  は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ又は $1 \sim 5$ 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルであり得る；

・  $R^{44}$  は、水素原子、フェニル、ベンジル、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $1 \sim 5$ 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキル、ヒドロキシ- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $1 \sim 5$ 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルチオ- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ- $C_1 - C_4$ -アルキル又は $1 \sim 5$ 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルコキシ- $C_1 - C_4$ -アルキルであり得る；

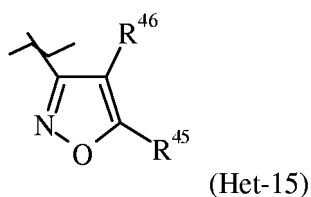
但し、 $R^{43}$  と  $R^{44}$  が両方とも水素原子であることはない]のヘテロ環を表す。

【0047】

\* Het は、一般式 (Het-15)

【0048】

【化16】



[式中、

・  $R^{45}$  は、水素原子、ハロゲン原子、 $C - C_4$ -アルキル又は $1 \sim 5$ 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルであり得る；

及び、

・  $R^{46}$  は、ハロゲン原子、 $C - C_4$ -アルキル又は $1 \sim 5$ 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルであり得る]

のヘテロ環を表す。

【0049】

\* Het は、一般式 (Het-16)

【0050】

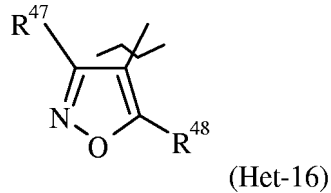
10

20

30

40

## 【化17】



[ 式中、

・ R<sup>47</sup> 及び R<sup>48</sup> は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルで場合により置換されていてもよいヘテロシクリルであり得る；

10

但し、R<sup>47</sup> と R<sup>48</sup> が両方とも水素原子であることはない ]  
のヘテロ環を表す。

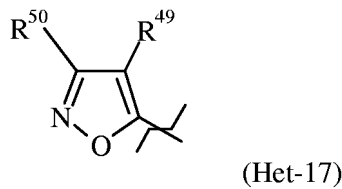
【0051】

\* Het は、一般式 (Het - 17)

【0052】

【化18】

20



[ 式中、

・ R<sup>49</sup> は、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る；

及び、

30

・ R<sup>50</sup> は、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る ]

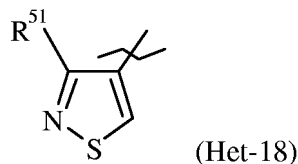
のヘテロ環を表す。

【0053】

\* Het は、一般式 (Het - 18)

【0054】

【化19】



40

[ 式中、

・ R<sup>51</sup> は、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る ]

のヘテロ環を表す。

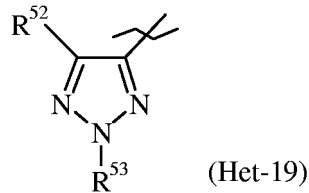
【0055】

\* Het は、一般式 (Het - 19)

【0056】



## 【化 2 0】



[ 式中、

・  $R^{52}$  は、ハロゲン原子、 $C_1 - C_4$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルであり得る；

及び、

・  $R^{53}$  は、水素原子、 $C_1 - C_4$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは  $C_1 - C_4$  - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルであり得る ]

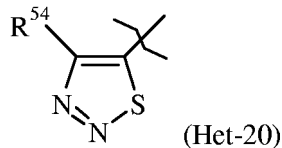
のヘテロ環を表す。

【 0 0 5 7】

\* Het は、一般式 ( Het - 2 0 )

【 0 0 5 8】

【化 2 1】



[ 式中、

・  $R^{54}$  は、ハロゲン原子、 $C_1 - C_4$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルであり得る ]

のヘテロ環を表す。

【 0 0 5 9】

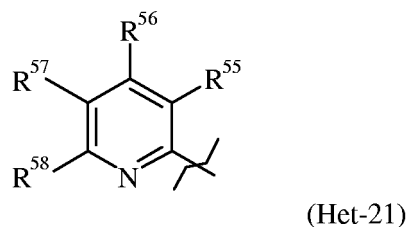
本発明では、一般式 ( I ) で表される化合物の「 Het 」は、6 員環式ヘテロ環であることができる。 Het が 6 員ヘテロ環である本発明化合物の特定例としては、以下のものを挙げるができる。

【 0 0 6 0】

\* Het は、一般式 ( Het - 2 1 )

【 0 0 6 1】

【化 2 2】



[ 式中、

・  $R^{55}$  は、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、 $C_1 - C_4$  - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルチオ又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルコキシであり得る；

・  $R^{56}$ 、 $R^{57}$  及び  $R^{58}$  は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 - C_4$  - アルキル、1 ~ 5 個のハロ

10

20

30

40

50

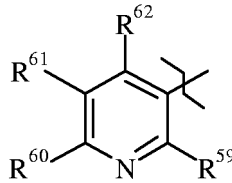
ゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキルスルフィニル又は  $C_1 - C_4$  - アルキルスルホニルであり得る ] のヘテロ環を表す。

【 0 0 6 2 】

\* Het は、一般式 ( Het - 2 2 )

【 0 0 6 3 】

【 化 2 3 】



(Het-22)

10

[ 式中、

・  $R^{59}$  は、水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、 $C_1 - C_4$  - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_5$  - アルキルチオ、 $C_2 - C_5$  - アルケニルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルチオ又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルコキシであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは  $C_1 - C_4$  - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルオキシであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは  $C_1 - C_4$  - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルチオであり得る；

20

・  $R^{60}$ 、 $R^{61}$  及び  $R^{62}$  は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 - C_4$  - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキルスルフィニル又は  $C_1 - C_4$  - アルキルスルホニルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは  $C_1 - C_4$  - アルキルで場合により置換されていてもよい N - モルホリンであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは  $C_1 - C_4$  - アルキルで場合により置換されていてもよいチエニルであり得る；

30

但し、 $R^{59}$  と  $R^{62}$  が両方とも水素原子であることはない ]

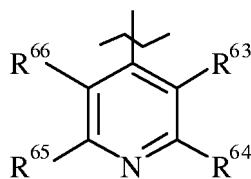
のヘテロ環を表す。

【 0 0 6 4 】

\* Het は、一般式 ( Het - 2 3 )

【 0 0 6 5 】

【 化 2 4 】



(Het-23)

40

[ 式中、

・  $R^{63}$ 、 $R^{64}$ 、 $R^{65}$  及び  $R^{66}$  は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、 $C_1 - C_4$  - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルコキ

50

シ、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルフィニル又は $C_1 - C_4$ -アルキルスルホニルであり得る；

但し、 $R^{63}$ と $R^{66}$ が両方とも水素原子であることはない]

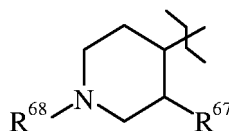
のヘテロ環を表す。

【0066】

\* Het は、一般式 (Het-24)

【0067】

【化25】



(Het-24)

10

[式中、

・  $R^{67}$  は、ハロゲン原子、 $C_1 - C_4$ -アルキル又は1~5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルであり得る；

・  $R^{68}$  は、水素原子、 $C_1 - C_4$ -アルキル、1~5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキル又は $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニルであり得るか、又は、1~3個のハロゲン原子で場合により置換されていてもよいベンジルであり得るか、又は、1~3個のハロゲン原子で場合により置換されていてもよいベンジルオキシカルボニルであり得るか、又は、ヘテロシクリルであり得る]

20

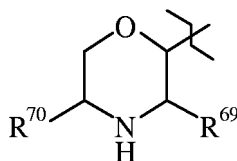
のヘテロ環を表す。

【0068】

\* Het は、一般式 (Het-25)

【0069】

【化26】



(Het-25)

30

[式中、

・  $R^{69}$  は、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、 $C_1 - C_4$ -アルキル、1~5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、1~5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルチオ又は1~5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルコキシであり得る；

・  $R^{70}$  は、水素原子、 $C_1 - C_4$ -アルキル、1~5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキル又はベンジルであり得る]

40

のヘテロ環を表す。

【0070】

\* Het は、一般式 (Het-26)

【0071】

## 【化27】



[ 式中、

- ・ X<sup>1</sup> は、硫黄原子、-SO-、-SO<sub>2</sub>- 又は -CH<sub>2</sub>- であり得る；
- ・ R<sup>71</sup> は、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル又は1～5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキルであり得る；

10

及び、

- ・ R<sup>72</sup> 及び R<sup>73</sup> は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子又はC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルであり得る]

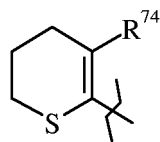
のヘテロ環を表す。

## 【0072】

- \* Het は、一般式 (Het-27)

## 【0073】

## 【化28】



(Het-27)

20

[ 式中、

- ・ R<sup>74</sup> は、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル又は1～5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキルであり得る]

のヘテロ環を表す。

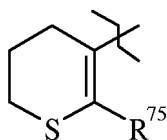
## 【0074】

- \* Het は、一般式 (Het-28)

30

## 【0075】

## 【化29】



(Het-28)

[ 式中、

- ・ R<sup>75</sup> は、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル又は1～5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキルであり得る]

40

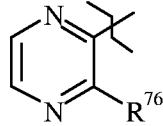
のヘテロ環を表す。

## 【0076】

- \* Het は、一般式 (Het-29)

## 【0077】

## 【化30】



(Het-29)

[式中、

・ R<sup>76</sup> は、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は1～5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る]  
のヘテロ環を表す。

10

## 【0078】

本発明では、一般式(I)の化合物の「A」基は、同一であっても又は異なってもよい1個、2個又は3個のヘテロ原子を有する5員環式非縮合ヘテロ環である。好ましくは、本発明は、一般式(I)で表されるヘテロシクリルエチルカルボキサミド誘導体に関し、ここで、種々の特性は、下記のものとして、単独で選択され得るか又は組み合わせて選択され得る：

・ Aは、同一であっても又は異なってもよい1個、2個又は3個のヘテロ原子を有する5員環式非縮合芳香族ヘテロ環であるように選択され、さらに好ましくは、Aは、2-チオフェン又は4-ピラゾールであるように選択される；及び、

20

・ Aは、オルト位が置換されている。

## 【0079】

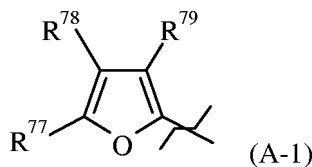
「A」基の特定例としては、以下のものを挙げるができる。

## 【0080】

\* Aは、一般式(A-1)

## 【0081】

## 【化31】



(A-1)

30

[式中、

・ R<sup>77</sup> 及び R<sup>78</sup> は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、アミノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は1～5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る；

及び、

・ R<sup>79</sup> は、ハロゲン原子、ニトロ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は1～5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る]  
のヘテロ環を表す。

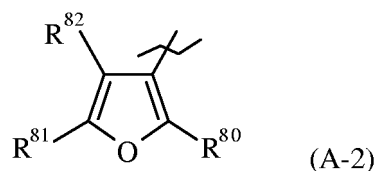
40

## 【0082】

\* Aは、一般式(A-2)

## 【0083】

## 【化32】



(A-2)

[式中、

・ R<sup>80</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は1～5個のハロゲ

50

ン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルであり得る；  
及び、

・  $R^{81}$  及び  $R^{82}$  は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、アミノ基、 $C_1 - C_4$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルであり得る；  
但し、 $R^{80}$  と  $R^{82}$  が両方とも水素原子であることはない]

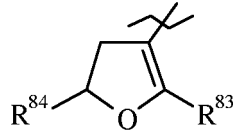
のヘテロ環を表す。

【0084】

\* A は、一般式 (A - 3)

【0085】

【化33】



(A-3)

[ 式中、

・  $R^{83}$  は、ハロゲン原子、 $C_1 - C_4$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルであり得る；  
及び、

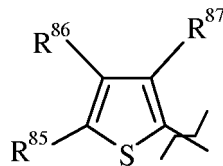
・  $R^{84}$  は、水素原子、 $C_1 - C_4$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルであり得る ]  
のヘテロ環を表す。

【0086】

\* A は、一般式 (A - 4)

【0087】

【化34】



(A-4)

[ 式中、

・  $R^{85}$  及び  $R^{86}$  は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_4$  - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルチオ又は  $C_1 - C_4$  - アルキルスルホニルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは  $C_1 - C_4$  - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは  $C_1 - C_4$  - アルキルで場合により置換されていてもよいピリジルであり得る；

及び、

・  $R^{87}$  は、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 - C_4$  - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルコキシであり得る ]

のヘテロ環を表す。

【0088】

\* A は、一般式 (A - 5)

【0089】

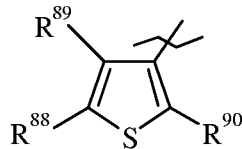
10

20

30

40

## 【化 3 5】



(A-5)

[ 式中、

・ R<sup>88</sup> 及び R<sup>89</sup> は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルオキシ又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る；

10

及び、

・ R<sup>90</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る；

但し、R<sup>89</sup> と R<sup>90</sup> が両方とも水素原子であることはない]

のヘテロ環を表す。

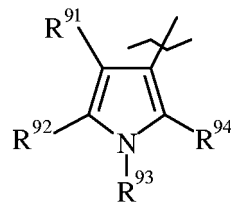
【 0 0 9 0 】

\* A は、一般式 ( A - 6 )

【 0 0 9 1 】

【化 3 6】

20



(A-6)

[ 式中、

・ R<sup>91</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る；

30

・ R<sup>92</sup> 及び R<sup>93</sup> は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る；

及び、

・ R<sup>94</sup> は、水素原子、シアノ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、ヒドロキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルスルホニル、ジ ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル ) アミノスルホニル又は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルスルホニルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルで

40

場合により置換されていてもよいベンゾイルであり得る；

但し、R<sup>91</sup> と R<sup>94</sup> が両方とも水素原子であることはない]

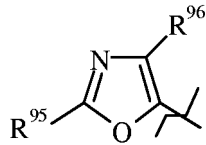
のヘテロ環を表す。

【 0 0 9 2 】

\* A は、一般式 ( A - 7 )

【 0 0 9 3 】

## 【化 37】



(A-7)

[ 式中、

・ R<sup>95</sup> は、水素原子又は C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり得る；  
及び、

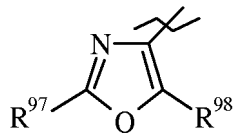
・ R<sup>96</sup> は、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る ]  
のヘテロ環を表す。

【 0094】

\* A は、一般式 ( A - 8 )

【 0095】

## 【化 38】



(A-8)

[ 式中、

・ R<sup>97</sup> は、水素原子又は C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり得る；  
及び、

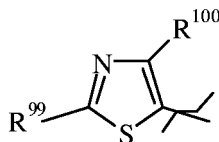
・ R<sup>98</sup> は、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルであり得る ]  
のヘテロ環を表す。

【 0096】

\* A は、一般式 ( A - 9 )

【 0097】

## 【化 39】



(A-9)

[ 式中、

・ R<sup>99</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、アミノ基、シアノ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルアミノ、ジ - ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル ) アミノ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルであり得る；  
及び、

・ R<sup>100</sup> は、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る ]  
のヘテロ環を表す。

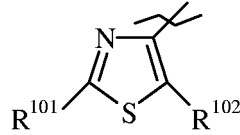
【 0098】

\* A は、一般式 ( A - 10 )

【 0099】



## 【化40】



(A-10)

[ 式中、

・ R<sup>101</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、アミノ基、シアノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルアミノ、ジ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル又は1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキルであり得る；

及び、

・ R<sup>102</sup> は、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル又は1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキルであり得る]

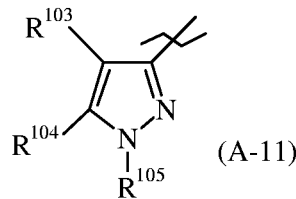
のヘテロ環を表す。

【0100】

\* Aは、一般式(A-11)

【0101】

【化41】



(A-11)

[ 式中、

・ R<sup>103</sup> は、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルチオ、1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキルチオ、アミノカルボニル基又はアミノカルボニル-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルであり得る；

・ R<sup>104</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ又はC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルチオであり得る；

及び、

・ R<sup>105</sup> は、水素原子、フェニル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキル、ヒドロキシ-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルチオ-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキルチオ-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル又は1~5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルコキシ-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルであり得る

]

のヘテロ環を表す。

【0102】

\* Aは、一般式(A-12)

【0103】

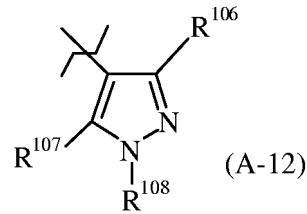
10

20

30

40

## 【化 4 2】



[ 式中、

・ R<sup>106</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルチオ、アミノカルボニル又はアミノカルボニル - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり得る；

・ R<sup>107</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルコキシ又は C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルチオであり得る；

及び、

・ R<sup>108</sup> は、水素原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキル、ヒドロキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルチオ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルチオ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり得るか、又は、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシアルキル若しくはニトロ基で場合により置換されていてもよいフェニルであり得る；

但し、R<sup>106</sup> と R<sup>107</sup> が両方とも水素原子であることはない]

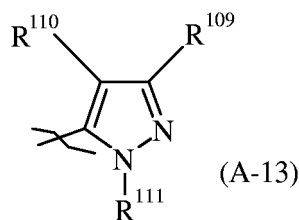
のヘテロ環を表す。

## 【0104】

\* A は、一般式 (A - 13)

## 【0105】

## 【化 4 3】



[ 式中、

・ R<sup>109</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルチオ、アミノカルボニル又はアミノカルボニル - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり得る；

・ R<sup>110</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルチオ又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る；

・ R<sup>111</sup> は、水素原子、フェニル、ベンジル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、1 ~ 5 個の

ハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキル、ヒドロキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルチオ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルチオ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキルであり得る；

但し、 $R^{110}$  と  $R^{111}$  が両方とも水素原子であることはない]

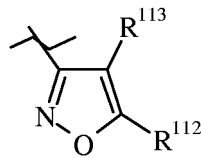
のヘテロ環を表す。

【0106】

\* A は、一般式 (A - 14)

【0107】

【化44】



(A-14)

[ 式中、

・  $R^{112}$  は、水素原子、ハロゲン原子、 $C - C_4$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルであり得る；

及び、

・  $R^{113}$  は、ハロゲン原子、 $C - C_4$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルであり得る]

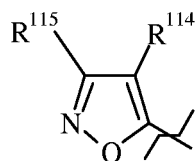
のヘテロ環を表す。

【0108】

\* A は、一般式 (A - 15)

【0109】

【化45】



(A-15)

[ 式中、

・  $R^{114}$  は、ハロゲン原子、 $C_1 - C_4$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルであり得る；

及び、

・  $R^{115}$  は、ハロゲン原子、 $C_1 - C_4$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルであり得る]

のヘテロ環を表す。

【0110】

\* A は、一般式 (A - 16)

【0111】

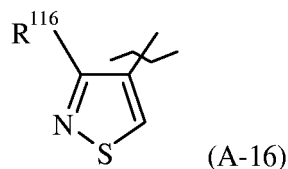
10

20

30

40

【化 4 6】



[ 式中、

・ R<sup>116</sup> は、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る ]  
 のヘテロ環を表す。

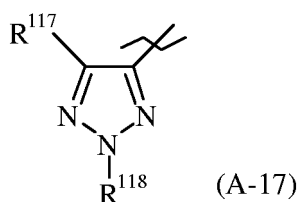
10

【 0 1 1 2】

\* A は、一般式 ( A - 1 7 )

【 0 1 1 3】

【化 4 7】



20

[ 式中、

・ R<sup>117</sup> は、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る ;

及び、

・ R<sup>118</sup> は、水素原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルであり得る ]

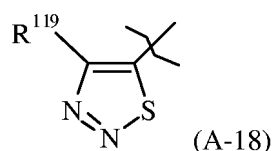
のヘテロ環を表す。

【 0 1 1 4】

\* A は、一般式 ( A - 1 8 )

【 0 1 1 5】

【化 4 8】



30

[ 式中、

・ R<sup>119</sup> は、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る ]

のヘテロ環を表す。

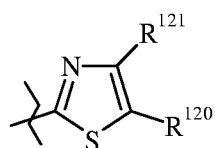
40

【 0 1 1 6】

\* A は、一般式 ( A - 1 9 )

【 0 1 1 7】

【化 4 9】



(A-19)

50

[ 式中、

・  $R^{120}$  は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 - C_6$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_6$  - ハロゲノアルキルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは  $C_1 - C_4$  - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルであり得る；

及び、

・  $R^{121}$  は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 - C_6$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_6$  - ハロゲノアルキルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは  $C_1 - C_4$  - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルであり得る ]

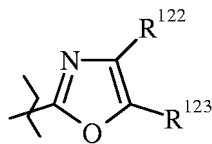
のヘテロ環を表す。

【 0 1 1 8 】

\* A は、一般式 ( A - 2 0 )

【 0 1 1 9 】

【 化 5 0 】



(A-20)

[ 式中、

・  $R^{122}$  は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 - C_6$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_6$  - ハロゲノアルキルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは  $C_1 - C_4$  - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルであり得る；

及び、

・  $R^{123}$  は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 - C_6$  - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_6$  - ハロゲノアルキルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは  $C_1 - C_4$  - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルであり得る ]

のヘテロ環を表す。

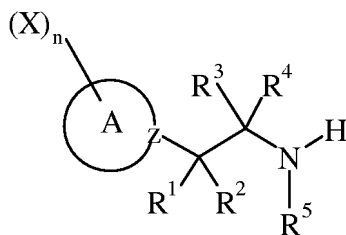
【 0 1 2 0 】

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

一般式 ( I I )

【 0 1 2 1 】

【 化 5 1 】



(II)

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

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

10

20

30

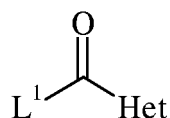
40

50

I I )

【 0 1 2 2 】

【 化 5 2 】



(III)

[ 式中、

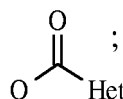
10

- ・ Het は、上記で定義されているとおりであり；

- ・ L<sup>1</sup> は、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、-OR<sup>1 2 4</sup> 又は -OCOR<sup>1 2 4</sup> であるように選択される脱離基であり、ここで、R<sup>1 2 4</sup> は、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、ベンジル、4-メトキシベンジル、ペンタフルオロフェニル又は式

【 0 1 2 3 】

【 化 5 3 】



20

で表される基である]

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

【 0 1 2 4 】

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

【 0 1 2 5 】

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

30

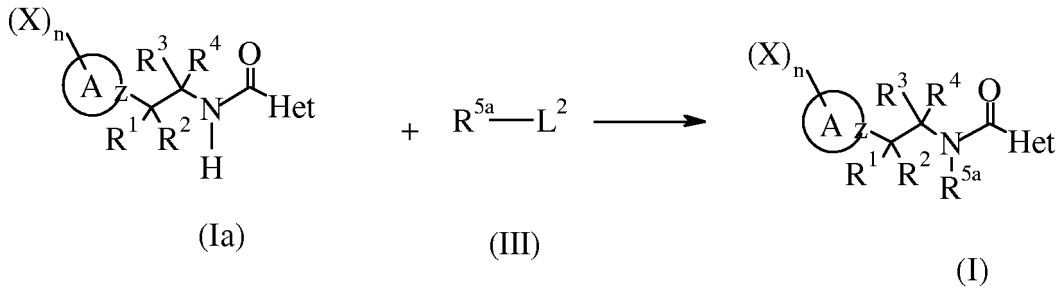
【 0 1 2 6 】

40

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

【 0 1 2 7 】

## 【化54】



[ここで、

10

・ A、X、n、z、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びHetは、上記で定義されているとおりであり；

・ R<sup>5a</sup>は、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル又はC<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-シクロアルキルであり；

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

に従うさらなるステップで場合により完結させることができる。

## 【0128】

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>又はR<sup>5</sup>の定義に応じて、一般式(II)で表されるアミン誘導体は、種々の調製方法で調製することができる。そのような調製方法の1つの例(A)は、以下のとおりであり得る：

20

・ X及びnが、上記で定義されているとおりであり；

・ R<sup>1</sup>が、水素原子又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルであり；

・ R<sup>2</sup>が、水素原子又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルであり；及び、

・ R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>が、水素原子である場合；

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

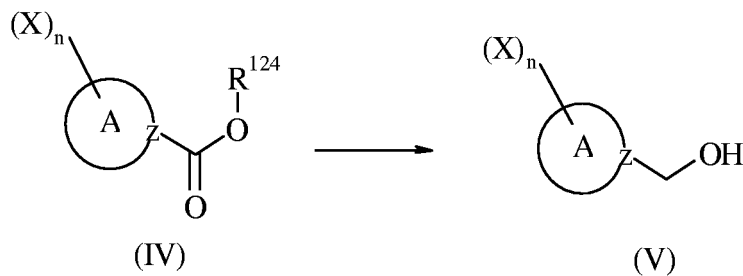
- 反応スキーム(A-1)による第1ステップ：

スキーム(A-1)

## 【0129】

## 【化55】

30



[ここで、

40

・ X、A、z及びnは、上記で定義されているとおりであり；

・ R<sup>124</sup>は、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルである]

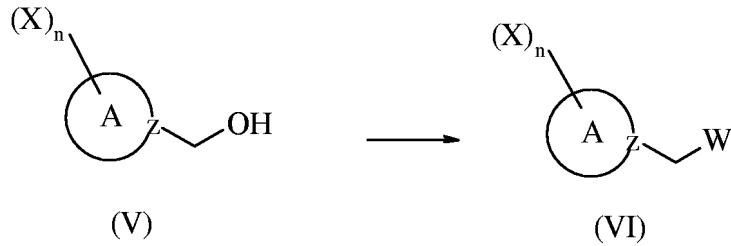
(ここで、該第1ステップは、一般式(IV)で表されるヘテロ環式カルボキシレート誘導体を、0~200の温度で、水素化物供与体の存在下に還元して、一般式(V)で表されるヘテロシクリル-メタノール含有誘導体を生成させることを含む)；

- 反応スキーム(A-2)による第2ステップ：

スキーム(A-2)

## 【0130】

## 【化56】



[ここで、

- ・ X、A、z 及び n は、上記で定義されているとおりであり；
- ・ W は、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホネート、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルスルホネート又は 4 - メチル - フェニルスルホネートである]

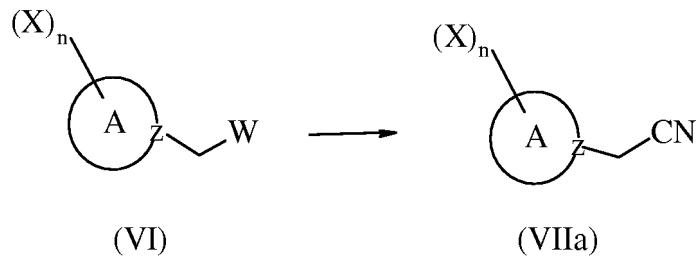
(ここで、該第2ステップは、一般式(V)で表される化合物を活性化して、一般式(VI)で表される化合物を生成させることを含む)；

- 反応スキーム(A-3)による第3ステップ：

スキーム(A-3)

## 【0131】

## 【化57】



[ここで、X、A、z 及び n は、上記で定義されているとおりである]

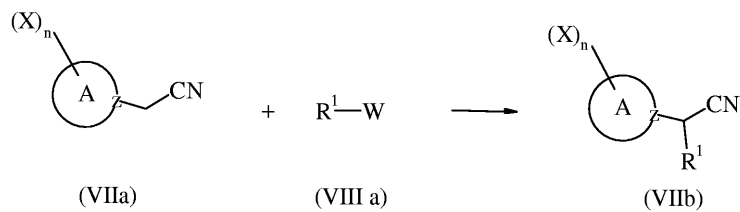
(ここで、該第3ステップは、一般式(VI)で表される化合物をシアン化物で置換して、一般式(VIIa)で表されるヘテロシクリルアセトニトリル誘導体を生成させることを含む)；

- 反応スキーム(A-4)による第4ステップ：

スキーム(A-4)

## 【0132】

## 【化58】



[ここで、

- ・ A、z、X 及び n は、上記で定義されているとおりであり；
- ・ R<sup>1</sup> は、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルであり；
- ・ W は、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホネート、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルするホネート又は 4 - メチル - フェニルスルホネートである]

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

- 反応スキーム(A-5)による第5ステップ：

スキーム(A-5)

10

20

30

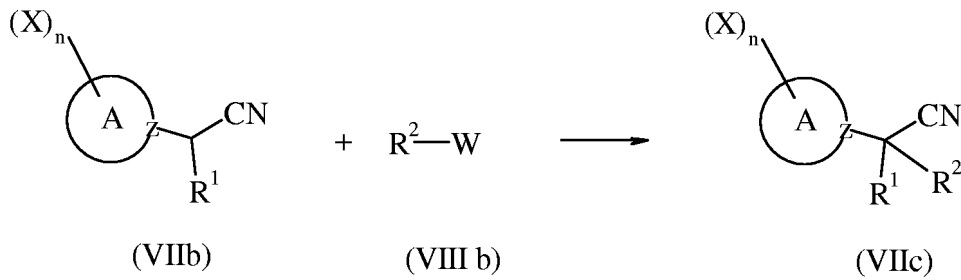
40

50



【 0 1 3 3 】

【 化 5 9 】



10

[ ここで、

- ・ X 及び n は、上記で定義されているとおりであり；
- ・ R<sup>1</sup> は、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルであり；
- ・ R<sup>2</sup> は、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルであり；
- ・ W は、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホネート、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキルするホネート又は 4 - メチル - フェニルスルホネートである ]

(ここで、該第 5 ステップは、一般式 (VII b) で表される化合物を一般式 (VII I b) で表される試薬でアルキル化して、一般式 (VII c) で表される化合物を生成させることを含む)；

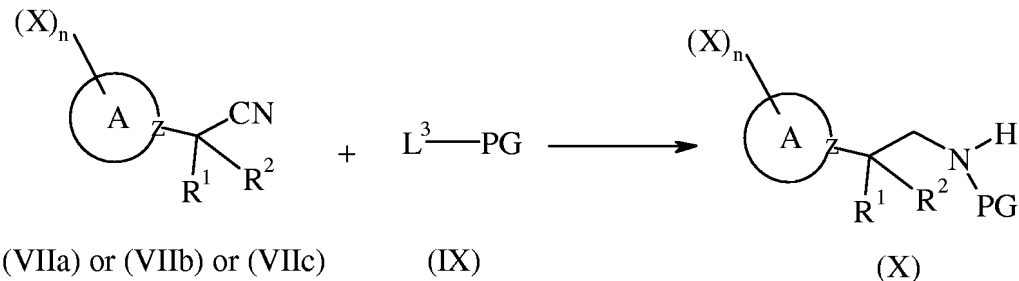
- 反応スキーム (A - 6) による第 6 ステップ：

スキーム (A - 6)

20

【 0 1 3 4 】

【 化 6 0 】



30

[ ここで、

- ・ X 及び n は、上記で定義されているとおりであり；
- ・ R<sup>1</sup> は、水素原子又は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルであり；
- ・ R<sup>2</sup> は、水素原子又は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルであり；
- ・ L<sup>3</sup> は、-OR<sup>1 2 5</sup> 基又は -OCOR<sup>1 2 5</sup> 基であるように選択される脱離基であり、ここで、R<sup>1 2 5</sup> は、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、ベンジル、4 - メトキシベンジル又はペンタフルオロフェニルであり；
- ・ PG は、保護基を表し、ここで、該保護基は、-COOR<sup>1 2 6</sup> 基又は -COR<sup>1 2 6</sup> 基 (ここで、R<sup>1 2 6</sup> は、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、ベンジル、4 - メトキシベンジル又はペンタフルオロフェニルである) であり得る ]

40

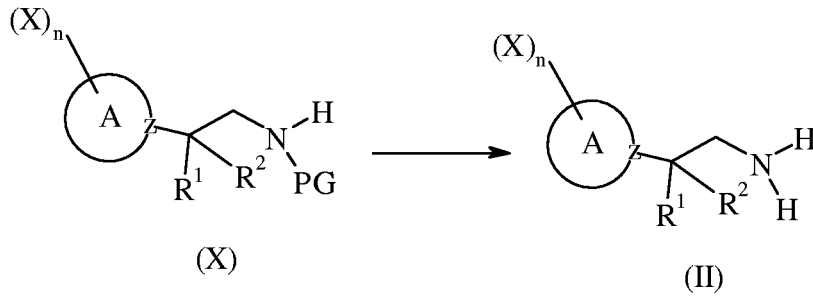
(ここで、該第 6 ステップは、触媒の存在下及び一般式 (IX) で表される化合物の存在下、0 ~ 150 の温度で、1 パール ~ 100 パールの圧力下に、一般式 (VII a)、一般式 (VII b) 又は一般式 (VII c) で表される化合物を水素化又は水素化物供与体により還元して、一般式 (X) で表される化合物を生成させることを含む)；

- 反応スキーム (A - 7) による第 7 ステップ：

スキーム (A - 7)

【 0 1 3 5 】

## 【化 6 1】



[ここで、

10

- ・ X 及び n は、上記で定義されているとおりであり
  - ・ R<sup>1</sup> は、水素原子又は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルであり；
  - ・ R<sup>2</sup> は、水素原子又は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルであり；
  - ・ PG は、保護基を表し、ここで、該保護基は、-COOR<sup>1,2,7</sup> 基又は -COR<sup>1,2,7</sup> 基（ここで、R<sup>1,2,7</sup> は、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロアルキル、ベンジル、4 - メトキシベンジル又はペンタフルオロフェニルである）であり得る]
- （ここで、該第 7 ステップは、酸性媒体又は塩基性媒体中で、一般式 (X) で表される化合物を脱保護反応に付して、一般式 (II) で表されるアミン誘導体又はその塩のうちの 1 種類を生成させることを含む）。

20

## 【0136】

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

## 【0137】

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

## 【0138】

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

30

## 【0139】

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

40

## 【0140】

本発明の第 5 ステップ（ステップ A - 5）は、水素化物供与体の存在下で実施する。好ましくは、該水素化物供与体は、LiAlH<sub>4</sub>、NaBH<sub>4</sub>、KBH<sub>4</sub>、B<sub>2</sub>H<sub>6</sub> などの

50

ような金属水素化物又は半金属水素化物であるように選択される。

【0141】

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

【0142】

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

10

【0143】

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

【0144】

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

【0145】

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

20

【0146】

当業者は、自分の一般的な知識及び利用可能な刊行物に基づいて、本発明の一般式(V)で表される中間体化合物を調製することもできる。

【0147】

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

30

【0148】

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

40

【0149】

上記組成物は、さらにまた、付加的な成分も含有することができる。特に、該組成物は、さらに、界面活性剤を含有することができる。該界面活性剤は、イオン性若しくは非イオン性のタイプの乳化剤、分散剤若しくは湿潤剤であることが可能であるか、又は、そのような界面活性剤の混合物であることが可能である。例えば、以下のものを挙げることができる: ポリアクリル酸塩、リグノスルホン酸塩、フェノールスルホン酸塩若しくはナフタレンスルホン酸塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールの重縮合物、エチレンオキシドと脂肪酸の重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪アミンの重縮合物、置換されているフェノール(特に、アルキルフェノール又はアリールフェノール)、スルホコハク酸エステル塩、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

50

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含んでいる上記化合物の誘導体。該活性物質及び/又は該不活性支持体が水不溶性である場合、及び、施用のための媒介物 (vector agent) が水である場合、一般に、少なくとも1種類の界面活性剤を存在させることが必要である。好ましくは、界面活性剤の含有量は、該組成物の5 ~ 40重量%であり得る。

【0150】

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。

10

【0151】

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

【0152】

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

20

【0153】

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商業的な濃厚組成物も包含される。

【0154】

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

30

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

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

40

(3) 呼吸を阻害し得る化合物、例えば、

C I - 呼吸阻害薬、例えば、ジフルメトリン；

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

C I I I - 呼吸阻害薬、例えば、アミスルプロム、アゾキシストロピン、シアゾファミド、ジモキシストロピン、エネストロピン (enestrobin)、ファモキサドン、フェンアミドン、フルオキサストロピン、クレソキシム - メチル、メトミノストロピン、オリサスト

50

ロビン、ピコキシストロビン、ピラクロストロビン、トリフロキシストロビン；

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

(14) 以下のリストから選択される化合物：(2E) - 2 - (2 - { [6 - (3 - クロロ - 2 - メチルフェノキシ) - 5 - フルオロピリミジン - 4 - イル] オキシ} フェニル) - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチルアセトアミド、(2E) - 2 - { 2 - [ ( { [ (1E) - 1 - (3 - { [ (E) - 1 - フルオロ - 2 - フェニルビニル] オキシ} フェニル) エチリデン] アミノ } オキシ) メチル] フェニル } - 2 - (メトキシイミノ) - N - メチルアセトアミド、1 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) シクロヘプタノール、1 - [ (4 - メトキシフェノキシ) メチル] - 2, 2 - ジメチルプロピル 1H - イミダゾール - 1 - カルボキシレート、2 - (4 - クロロフェニル) - N - { 2 - [ 3 - メトキシ - 4 - (プロブ - 2 - イン - 1 - イルオキシ

10

20

30

40

50

)フェニル]エチル}-2-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)アセトアミド、2、  
 3、5、6-テトラクロロ-4-(メチルスルホニル)ピリジン、2-プトキシ-6-ヨ  
 ード-3-プロピル-4H-クロメン-4-オン、2-クロロ-N-(1,1,3-トリ  
 メチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ニコチンアミド、2-フェニル  
 フェノール及び塩、3,4,5-トリクロロピリジン-2,6-ジカルボニトリル、3、  
 4-ジクロロ-N-(2-シアノフェニル)イソチアゾール-5-カルボキサミド、3-  
 [5-(4-クロロフェニル)-2,3-ジメチルイソオキサゾリジン-3-イル]ピリ  
 ジン、5-クロロ-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-N-[(1R)-1,  
 2,2-トリメチルプロピル][1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン-7  
 -アミン、5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-  
 トリフルオロフェニル)[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン、5-クロ  
 ロ-N-[(1R)-1,2-ジメチルプロピル]-6-(2,4,6-トリフルオロフェ  
 ニル)[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン-7-アミン、8-ヒドロ  
 キシキノリンスルフェート、ベンチアゾール、ベトキサジン、カプシマイシン(capsimyc  
 in)、カルボン、キノメチオネート、クフラネブ、シフルフェナミド、シモキサニル、ダ  
 ザメット、デバカルブ(debacarb)、ジクロロフェン、ジクロメジン、ジクロラン、ジフ  
 エンゾコート、ジフェンゾコートメチル硫酸塩、ジフェニルアミン、フェリムゾン、フル  
 メトベル、フルオピコリド、フルオルイミド、フルスルファミド、ホセチル-アルミニウ  
 ム、ホセチル-カルシウム、ホセチル-ナトリウム、ヘキサクロロベンゼン、イルマイ  
 シン、メタスルホカルブ、(2-クロロ-5-{(1E)-N-[(6-メチルピリジン  
 -2-イル)メトキシ]エタンイミドイル}ベンジル)カルバミン酸メチル、(2E)-  
 2-{2-[(シクロプロピル[(4-メトキシフェニル)イミノ]メチル}チオ)メ  
 チル]フェニル}-3-メトキシアクリル酸メチル、1-(2,2-ジメチル-2,3-  
 ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-1H-イミダゾール-5-カルボン酸メチル、  
 3-(4-クロロフェニル)-3-{[N-(イソプロポキシカルボニル)バリル]アミ  
 ノ}プロパン酸メチル、イソチオシアン酸メチル、メトラフェノン、ミルディオマイシン  
 、N-(3',4'-ジクロロ-5-フルオロピフェニル-2-イル)-3-(ジフルオ  
 ロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、N-(3-エチル-  
 3,5,5-トリメチルシクロヘキシル)-3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシベ  
 ンズアミド、N-(4-クロロ-2-ニトロフェニル)-N-エチル-4-メチルベンゼ  
 ンスルホンアミド、N-[(5-プロモ-3-クロロピリジン-2-イル)メチル]-2  
 ,4-ジクロロニコチンアミド、N-[1-(5-プロモ-3-クロロピリジン-2-イ  
 ル)エチル]-2,4-ジクロロニコトニンアミド、N-[1-(5-プロモ-3-クロロ  
 ピリジン-2-イル)エチル]-2-フルオロ-4-ヨードニコチンアミド、N-[2-  
 (4-{[3-(4-クロロフェニル)プロブ-2-イン-1-イル]オキシ}-3-メ  
 トキシフェニル)エチル]-N<sup>2</sup>-N<sup>2</sup>-(メチルスルホニル)バリン  
 アミド、N-{(Z)-[(シクロプロピルメトキシ)イミノ][6-(ジフルオロメト  
 キシ)-2,3-ジフルオロフェニル]メチル}-2-フェニルアセトアミド、N-{2  
 -[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]エチル}-2-(ト  
 リフルオロメチル)ベンズアミド、ナタマイシン、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル  
 、ニトロタル-イソプロピル、O-{1-[(4-メトキシフェノキシ)メチル]-2,  
 2-ジメチルプロピル}1H-イミダゾール-1-カルボチオエート、オクチリノン、  
 オキサモカルブ(oxamocarb)、オキシフェンチイン(oxyfenthiin)、ペンタクロロフェ  
 ノール及び塩、亜リン酸及びその塩、ピペラリン、プロパモカルブホセチレート(propam  
 ocarb fosetyl late)、プロパノシン-ナトリウム(propanosine-sodium)、プロキナジ  
 ド、ピロールニトリン、キントゼン、テクロフタラム、テクナゼン、トリアゾキシド、ト  
 リクラミド、並びに、ザリラミド。

【0155】

式(I)で表される化合物と殺細菌活性化合物の混合物を含んでいる本発明の組成物も  
 、特に有利であり得る。適切な混合相手殺細菌剤の例は、以下のリストの中で選択し得る

10

20

30

40

50

：プロノポール、ジクロロフェン、ニトラピリン、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、カスガマイシン、オクチリノン、フランカルボン酸、オキシテトラサイクリン、プロベナゾール、ストレプトマイシン、テクロフタラム、硫酸銅及び他の銅剤。

【0156】

本発明の殺菌剤組成物を使用して、作物の植物病原性菌類を治療的又は予防的に防除することができる。かくして、本発明のさらに別の態様により、作物の植物病原性菌類を治療的又は予防的に防除する方法が提供され、ここで、該方法は、上記で定義した殺菌剤組成物を、種子、植物及び/若しくは植物の果実に施用するか、又は、植物が成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。

【0157】

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

【0158】

「有効で且つ植物に対して毒性を示さない量」という表現は、作物上に存在しているか又はおそらく出現するであろう菌類を防除又は駆除するのに充分で、且つ、該作物について植物毒性の感知可能などのような症状も引き起こすことのない、本発明組成物の量を意味する。そのような量は、防除対象の菌類、作物のタイプ、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。

【0159】

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。

【0160】

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

【0161】

本発明の方法で保護可能な植物の中で、以下のものを挙げることができる：ワタ；アマ；ブドウ；果実又は野菜、例えば、ロサセアエ属種(Rosaceae sp.) (例えば、ピップフルーツ(pip fruit)、例えば、リンゴ及びナシ、さらに、核果、例えば、アンズ、アーモンド及びモモ)、リベシオイダエ属種(Ribesioideae sp.)、ジュグランダセアエ属種(Juglandaceae sp.)、ベツラセアエ属種(Betulaceae sp.)、アナカルジアセアエ属種(Anacardiaceae sp.)、ファガセアエ属種(Fagaceae sp.)、モラセアエ属種(Moraceae sp.)、オレアセアエ属種(Oleaceae sp.)、アクチニダセアエ属種(Actinidaceae sp.)、ラウラセアエ属種(Lauraceae sp.)、ムサセアエ属種(Musaceae sp.) (例えば、バナナの木及びプランタン)、ルビアセアエ属種(Rubiaceae sp.)、テアセアエ属種(Theaceae sp.)、ステルクリセアエ属種(Sterculiaceae sp.)、ルタセアエ属種(Rutaceae sp.) (例えば、レモン、オレンジ及びグレープフルーツ)；ソラナセアエ属種(Solanaceae sp.) (例えば、トマト)、リリアセアエ属種(Liliaceae sp.)、アステラセアエ属種(Asteraceae sp.) (例えば、レタス)、ウムベリフェラエ属種(Umbelliferae sp.)、クルシフェラエ属種(Cruciferae sp.)、ケノボジアセアエ属種(Chenopodiaceae sp.)、ククルビタセアエ属種(Cucurbitaceae sp.)、ラピリオナセアエ属種(Papilionaceae sp.) (例えば、エンドウ)、ロサセアエ属種(Rosaceae sp.) (例えば、イチゴ)；主要作物(major crop)、例えば、グラミナエ属種(Graminae sp.) (例えば、トウモロコシ、芝、又は、禾穀類、例えば、コムギ、イネ、オオムギ及びライコムギ)、アステラセアエ属種(Asteraceae sp.) (例えば、ヒマワリ)、クルシフェラエ属種(Cruciferae sp.) (例えば、なたね)、ファバカエ属種(Fabaceae sp.) (例えば、ピーナッツ)、ラピリオナセアエ属種(Papilionaceae sp.) (例えば、ダイズ)、ソラナセアエ属種(Solanaceae sp.) (例えば、ジャガイモ)、ケ

10

20

30

40

50

ノポジアセアエ属種 (Chenopodiaceae sp.) (例えば、ビートルート (beetroot)) ; 園芸作物及び森林作物 (forest crops) ; さらに、これら作物の遺伝子組み換えが行われた相同物。

【0162】

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

- ・ うどんこ病 (powdery mildew disease)、例えば、ブルメリア (Blumeria) 病、例えば、ブルメリア・グラミニス (Blumeria graminis) に起因するもの ;

- ・ ポドスファエラ (Podosphaera) 病、例えば、ポドスファエラ・レウコトリカ (Podosphaera leucotricha) に起因するもの ;

- ・ スファエロテカ (Sphaerotheca) 病、例えば、スファエロテカ・フリギネア (Sphaerotheca fuliginea) に起因するもの ;

- ・ ウンシヌラ (Uncinula) 病、例えば、ウンシヌラ・ネカトル (Uncinula necator) に起因するもの ;

- ・ さび病 (rust disease)、例えば、

- ・ ギムノスポランギウム (Gymnosporangium) 病、例えば、ギムノスポランギウム・サビナエ (Gymnosporangium sabiniae) に起因するもの ;

- ・ ヘミレイア (Hemileia) 病、例えば、ヘミレイア・バスタトリクス (Hemileia vastatrix) に起因するもの ;

- ・ ファコプソラ (Phakopsora) 病、例えば、ファコプソラ・パキリジ (Phakopsora pachyrhizi) 又はファコプソラ・メイボミアエ (Phakopsora meibomiae) に起因するもの ;

- ・ プッシニア (Puccinia) 病、例えば、プッシニア・レコンジタ (Puccinia recondita) に起因するもの ;

- ・ ウロミセス (Uromyces) 病、例えば、ウロミセス・アペンジクラツス (Uromyces appendiculatus) に起因するもの ;

- ・ 卵菌類による病害 (Oomycete disease)、例えば、

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

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

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

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

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

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

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

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

- ・ セルコスボラ (Cercospora) 病、例えば、セルコスボラ・ベチコラ (Cercospora beticola) に起因するもの ;

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

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

10

20

30

40

50



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

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

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

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

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

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

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

レプトスファエリア (Leptosphaeria) 病、例えば、レプトスファエリア・マクランズ (Leptosphaeria maculans) 又はレプトスファエリア・ノドルム (Leptosphaeria nodorum) に起因するもの；

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

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

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

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

ラムラリア (Ramularia) 病、例えば、ラムラリア・コロ・シグニ (Ramularia collycygni) に起因するもの；

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

10

20

30

40

50

- ・ 穂の病害 (ear and panicle disease)、例えば、アルテルナリア (*Alternaria*) 病、例えば、アルテルナリア属種 (*Alternaria* spp.) に起因するもの；
- アスペルギルス (*Aspergillus*) 病、例えば、アスペルギルス・フラブス (*Aspergillus flavus*) に起因するもの；
- クラドスポリウム (*Cladosporium*) 病、例えば、クラドスポリウム属種 (*Cladosporium* spp.) に起因するもの；
- クラビセプス (*Claviceps*) 病、例えば、クラビセプス・プルブレア (*Claviceps purpurea*) に起因するもの；
- フサリウム (*Fusarium*) 病、例えば、フサリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*) に起因するもの；
- ジベレラ (*Gibberella*) 病、例えば、ジベレラ・ゼアエ (*Gibberella zeae*) に起因するもの；
- モノグラフェラ (*Monographella*) 病、例えば、モノグラフェラ・ニバリス (*Monographella nivalis*) に起因するもの；
- ・ 黒穂病 (smut and bunt disease)、例えば、スファセロテカ (*Sphacelotheca*) 病、例えば、スファセロテカ・レイリアナ (*Sphacelotheca reiliana*) に起因するもの；
- チレチア (*Tilletia*) 病、例えば、チレチア・カリエス (*Tilletia caries*) に起因するもの；
- ウロシスチス (*Urocystis*) 病、例えば、ウロシスチス・オクルタ (*Urocystis occulta*) に起因するもの；
- ウスチラゴ (*Ustilago*) 病、例えば、ウスチラゴ・ヌダ (*Ustilago nuda*) に起因するもの；
- ・ 果実の腐敗性及び黴性の病害 (fruit rot and mould disease)、例えば、アスペルギルス (*Aspergillus*) 病、例えば、アスペルギルス・フラブス (*Aspergillus flavus*) に起因するもの；
- ボトリチス (*Botrytis*) 病、例えば、ボトリチス・シネレア (*Botrytis cinerea*) に起因するもの；
- ペニシリウム (*Penicillium*) 病、例えば、ペニシリウム・エクспанスム (*Penicillium expansum*) に起因するもの；
- スクレロチニア (*Sclerotinia*) 病、例えば、スクレロチニア・スクレロチオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*) に起因するもの；
- ベルチシリウム (*Verticillium*) 病、例えば、ベルチシリウム・アルボアトルム (*Verticillium albo-atrum*) に起因するもの；
- ・ 種子及び土壌の腐朽性、黴性、萎凋性、腐敗性及び苗立ち枯れ性の病害 (seed and soilborne decay, mould, wilt, rot and damping-off disease)、
- フサリウム (*Fusarium*) 病、例えば、フサリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*) に起因するもの；
- フィトフトラ (*Phytophthora*) 病、例えば、フィトフトラ・カクトルム (*Phytophthora cactorum*) に起因するもの；
- ピシウム (*Pythium*) 病、例えば、ピシウム・ウルチムム (*Pythium ultimum*) に起因するもの；
- リゾクトニア (*Rhizoctonia*) 病、例えば、リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) に起因するもの；
- スクレロチウム (*Sclerotium*) 病、例えば、スクレロチウム・ロルフシイ (*Sclerotium rolfsii*) に起因するもの；
- ミクロドキウム (*Microdochium*) 病、例えば、ミクロドキウム・ニバレ (*Microdochium nivale*) に起因するもの；
- ・ 腐乱性病害、開花病及び枯れ込み性病害 (canker, broom and dieback diseases)

e)、例えば、

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

- ・ 枯損性病害 (blight disease)、例えば、

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

- ・ 葉水泡性病害又は縮葉病 (leaf blister or leaf curl disease)、例えば、タフリナ (*Taphrina*) 病、例えば、タフリナ・デホルマンズ (*Taphrina deformans*) に起因するもの；

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

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

- ・ 花及び種子の病害、例えば、

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

- ・ 塊茎の病害、例えば、

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

#### 【0163】

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

#### 【0164】

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

#### 【0165】

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

#### 【0166】

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

#### 【0167】

本発明の態様について、化合物についての下記表及び下記実施例を参照して説明する。以下の表は、本発明の殺菌性化合物の例について非限定的に例証している。下記実施例に

10

20

30

40

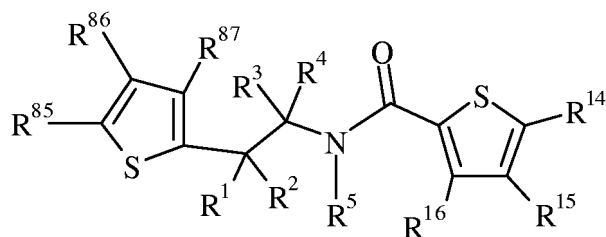
50

において、「M + 1」（又は、「M - 1」）は、それぞれ、質量分析において観察された分子イオンピークプラス 1 a . m . u .（原子質量単位）又はマイナス 1 a . m . u .（原子質量単位）を意味し、M（A p c I +）は、質量分析におけるポジティブ大気圧化学イオン化法で見いだされた分子イオンピークを意味する。

【 0 1 6 8 】

【 化 6 2 】

表 A



10

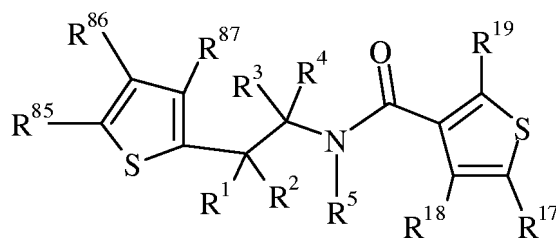
化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>85</sup>	R <sup>86</sup>	R <sup>87</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>16</sup>	M+1
A-1	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	H	I	398
A-2	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	Me	266
A-3	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	I	378
A-4	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	Br	330

20

【 0 1 6 9 】

【 化 6 3 】

表 B



30

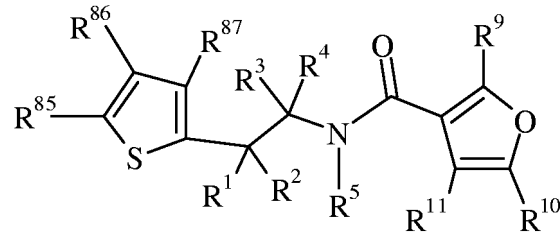
化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>85</sup>	R <sup>86</sup>	R <sup>87</sup>	R <sup>17</sup>	R <sup>18</sup>	R <sup>19</sup>	M+1
B-1	H	H	H	H	H	H	H	Me	H	H	I	378

40

【 0 1 7 0 】

【化 6 4】

表 C



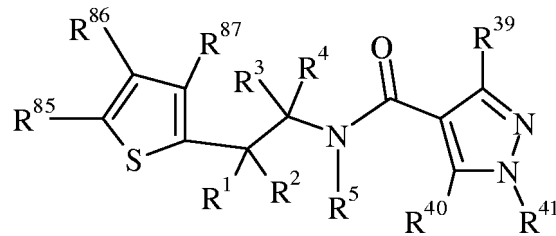
10

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>85</sup>	R <sup>86</sup>	R <sup>87</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	M+1
C-1	H	H	H	H	H	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	Me	H	318

【 0 1 7 1】

【化 6 5】

表 D



20

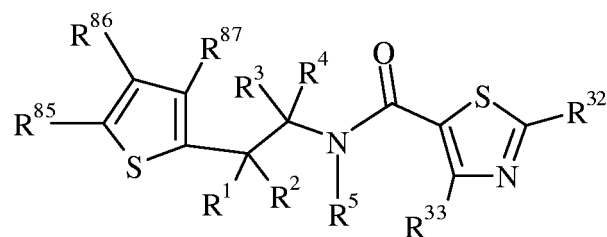
化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>85</sup>	R <sup>86</sup>	R <sup>87</sup>	R <sup>39</sup>	R <sup>40</sup>	R <sup>41</sup>	M+1
D-1	H	H	H	H	H	H	H	Me	CHF <sub>2</sub>	H	Me	300
D-2	H	H	H	H	H	H	H	Me	CF <sub>3</sub>	H	Me	318
D-3	H	H	H	H	H	H	H	Cl	CF <sub>3</sub>	H	Me	338
D-4	H	H	H	H	H	H	H	Cl	CHF <sub>2</sub>	H	Me	320

30

【 0 1 7 2】

【化 6 6】

表 E



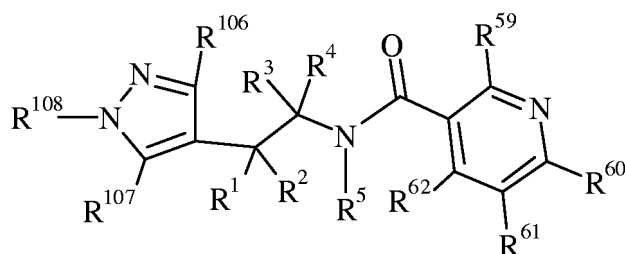
10

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>85</sup>	R <sup>86</sup>	R <sup>87</sup>	R <sup>32</sup>	R <sup>33</sup>	M+1
E-1	H	H	H	H	H	H	H	Me	Me	CF <sub>3</sub>	335
E-2	H	H	H	H	H	H	H	Cl	Me	CF <sub>3</sub>	355

【 0 1 7 3】

【化 6 7】

表 F



20

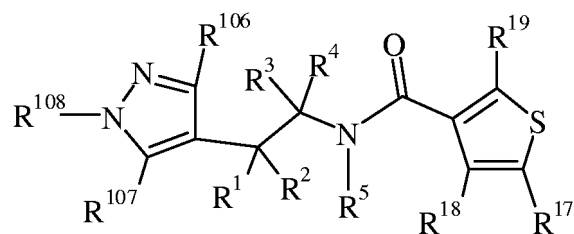
化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>106</sup>	R <sup>107</sup>	R <sup>108</sup>	R <sup>59</sup>	R <sup>60</sup>	R <sup>61</sup>	R <sup>62</sup>	M+1
F-1	H	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	Me	Cl	H	H	H	333

30

【 0 1 7 4】

【化 6 8】

表 G



40

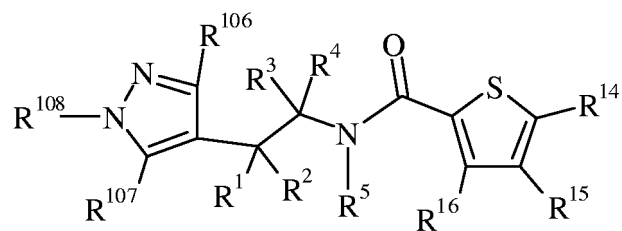
化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>106</sup>	R <sup>107</sup>	R <sup>108</sup>	R <sup>17</sup>	R <sup>18</sup>	R <sup>19</sup>	M+1
G-1	H	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	I	430

【 0 1 7 5】

50

【化 6 9】

表 H



10

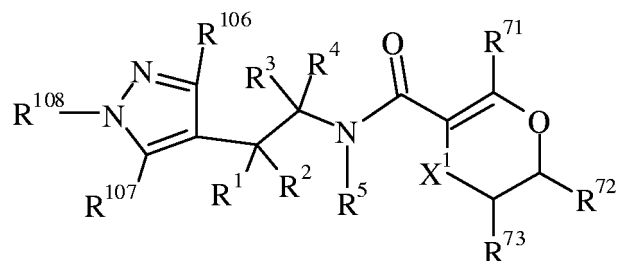
化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>106</sup>	R <sup>107</sup>	R <sup>108</sup>	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>	R <sup>16</sup>	M+1
H-1	H	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	Me	318
H-2	H	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	Br	382
H-3	H	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	Cl	338
H-4	H	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	Me	H	H	I	430

20

【 0 1 7 6】

【化 7 0】

表 I



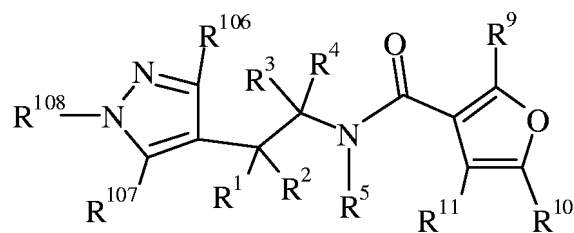
30

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>106</sup>	R <sup>107</sup>	R <sup>108</sup>	R <sup>71</sup>	R <sup>72</sup>	R <sup>73</sup>	X <sup>1</sup>	M+1
I-1	H	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	Me	CF <sub>3</sub>	H	H	S	390
I-2	H	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	Me	Me	H	H	S	336

【 0 1 7 7】

【化 7 1】

表 J



化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>106</sup>	R <sup>107</sup>	R <sup>108</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	M+1
J-1	H	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	Me	Me	Me	H	316
J-2	H	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	Me	Me	H	H	302
J-3	H	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	Me	CF <sub>3</sub>	Me	H	370
J-4	H	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	Me	I	H	H	414

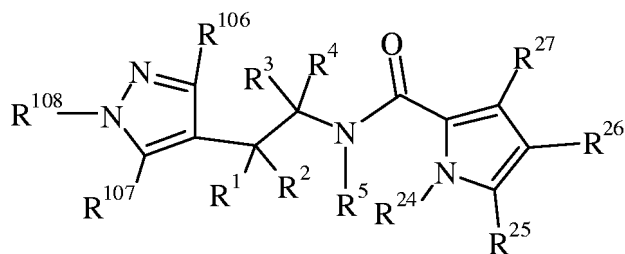
10

20

【 0 1 7 8】

【化 7 2】

表 K



30

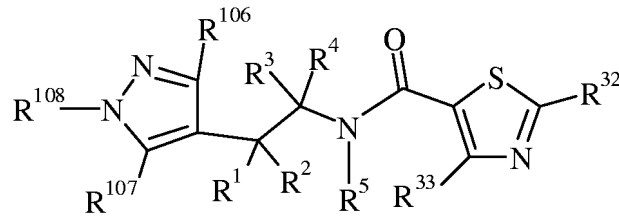
化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>106</sup>	R <sup>107</sup>	R <sup>108</sup>	R <sup>24</sup>	R <sup>25</sup>	R <sup>26</sup>	R <sup>27</sup>	M+1
K-1	H	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	Me	Me	H	H	I	427

【 0 1 7 9】



## 【化 7 3】

表 L



10

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>106</sup>	R <sup>107</sup>	R <sup>108</sup>	R <sup>32</sup>	R <sup>33</sup>	M+1
L-1	H	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	Me	Me	CF <sub>3</sub>	387

## 【0180】

一般式 (I) で表される化合物の調製方法についての実施例

3 - ヨード - N - { 2 - [ 1 - メチル - 4 - ( トリフルオロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] エチル } チオフェン - 2 - カルボキサミド ( 化合物 ( H - 4 ) ) の合成  
{ 2 - [ 1 - メチル - 4 - ( トリフルオロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] エチル } カルバミン酸 t - ブチルの調製

20

室温で、メタノール ( 10 mL ) に、[ 1 - メチル - 4 - ( トリフルオロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] アセトニトリル ( 4 . 76 mmol , 0 . 90 g )、炭酸ジ - t - ブチル ( 9 . 52 mmol , 2 . 08 g ) 及び塩化ニッケル六水和物 ( 4 . 77 mmol , 1 . 13 g ) を添加する。その反応混合物に、水素化ホウ素ナトリウム ( 13 . 1 mmol , 0 . 49 g ) を少量ずつ添加する。その反応混合物を室温とし、3 時間攪拌する。

## 【0181】

セライトのパッドで濾過し、減圧下に濃縮した後、得られた粗物質に 50 mL の酢酸エチルを添加し、50 mL の水で 2 回洗浄する。有機相を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、減圧下に濃縮して、1 . 90 g ( 57% ) の本質的に純粋な { 2 - [ 1 - メチル - 4 - ( トリフルオロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] エチル } カルバミン酸 t - ブチルを得る。

30

質量スペクトル : [ M + 1 ] = 294 .

## 【0182】

2 - [ 1 - メチル - 4 - ( トリフルオロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] エタンアミンの調製

{ 2 - [ 1 - メチル - 4 - ( トリフルオロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] エチル } カルバミン酸 t - ブチル ( 6 . 48 mmol , 1 . 9 g ) を 30 mL のジクロロメタンに溶解させる。室温で、トリフルオロ酢酸 ( 3 mL ) を添加する。室温で 2 時間攪拌した後、その反応混合物を減圧下に濃縮する。酢酸エチル ( 10 mL ) を添加し、次いで、10 mL の塩化水素酸 ( 1 M ) を添加する。

40

## 【0183】

分離後、水酸化ナトリウム ( 30% ) を用いて水相の pH を 12 に調節し、20 mL の酢酸エチルで抽出する。有機相を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、濃縮して、456 mg の本質的に純粋な 2 - [ 1 - メチル - 4 - ( トリフルオロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] エタンアミン ( 37% ) を得る。

<sup>1</sup>H NMR CDCl<sub>3</sub> : d ( ppm ) : 7 . 30 ( 1 H , s ) ; 3 . 85 ( 3 H , s ) ; 2 . 80 ( 2 H , m ) ; 2 . 65 ( 2 H , m ) .

## 【0184】

50

3 - ヨード - N - { 2 - [ 1 - メチル - 4 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] エチル } チオフェン - 2 - カルボキサミド (化合物 (H - 4) ) の調製

90 mg の 2 - [ 1 - メチル - 4 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] エタンアミン ( 0 . 0 0 0 4 7 m o l )、139 mg の 3 - ヨードチオフェン - 2 - カルボキシン酸 ( 0 . 0 0 0 5 5 m o l )、332 mg のベンゾトリアゾール - 1 - イル オキシトリス (ジメチルアミノ) ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート ( 0 . 0 0 0 7 1 m o l ) 及び 163  $\mu$  L の N , N - ジイソプロピルエチルアミン ( 0 . 0 0 0 9 3 m o l ) を、6 mL のアセトニリル中で、室温で一晩攪拌する。

【0185】

その反応混合物を濃縮乾固させ、シリカで生成して、120 mg の 3 - ヨード - N - { 2 - [ 1 - メチル - 4 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] エチル } チオフェン - 2 - カルボキサミド ( 6 0 % ) を得る。

質量スペクトル：[ M + 1 ] = 430。

【0186】

一般式 ( I ) で表される化合物の生物学的活性についての実施例

実施例 A : アルテルナリア・ブラシカエ ( *Alternaria brassicae* ) に対するインビボ試験

被験活性成分を、ポッター均質化 ( potter homogenisation ) により、100 g / L の濃厚懸濁液型製剤として調製する。次いで、この懸濁液を水で希釈して、所望の活性物質濃度とする。

【0187】

50 / 50 の泥炭土 - ポゾランの底土に播種し、18 ~ 20 で生育させたスターターカップ ( starter cup ) 内のハツカダイコン植物 ( 品種 P e r n o t ) を、子葉期で、上記水性懸濁液を噴霧することにより処理する。

【0188】

対照として使用する植物は、活性物質を含んでいない水溶液で処理する。

【0189】

24 時間経過した後、アルテルナリア・ブラシカエ ( *Alternaria brassicae* ) の胞子の水性懸濁液 ( 1 c m <sup>3</sup> 当たり 40 , 0 0 0 胞子 ) を噴霧することにより、該植物を汚染する。その胞子は、12 ~ 13 日間培養したものから採取する。

【0190】

汚染されたハツカダイコン植物を、湿潤雰囲気下、約 18 で、6 ~ 7 日間インキュベートする。

【0191】

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

【0192】

これらの条件下、以下の化合物を 330 p p m の薬量で用いて、良好な保護 ( 少なくとも 50 % ) から完全な保護が観察される：A - 2、A - 4、B - 1、C - 1、D - 4、I - 1、J - 4、及び、K - I。

【0193】

これらの条件下、以下の化合物を 110 p p m の薬量で用いて、良好な保護 ( 少なくとも 50 % ) から完全な保護が観察される：J - 3。

【0194】

実施例 B : ピレノホラ・テレス ( *Pyrenophora teres* ) に対するインビボ試験

被験活性成分を、ポッター均質化により、100 g / L の濃厚懸濁液型製剤として調製する。次いで、この懸濁液を水で希釈して、所望の活性物質濃度とする。

【0195】

50 / 50 の泥炭土 - ポゾランの底土に播種し、12 で生育させたスターターカップ内のオオムギ植物 ( 品種 E x p r e s s ) を、1 葉期 ( 草丈 10 c m ) で、上記水性懸濁液を噴霧することにより処理する。対照として使用する植物は、活性物質を含んでいな

10

20

30

40

50

い水溶液で処理する。

【0196】

24時間経過した後、ピレノホラ・テレス (*Pyrenophora teres*) の孢子の水性懸濁液 (1 mL 当たり 12,000 孢子) を噴霧することにより、該植物を汚染する。その孢子は、12日間培養したものから採取する。汚染されたオオムギ植物を、約20%、相対湿度100%で24時間インキュベートし、次いで、相対湿度80%で12日間インキュベートする。

【0197】

上記汚染から12日間経過した後、対照植物と比較して、等級付けを行う。

【0198】

これらの条件下、以下の化合物を330 ppmの薬量で用いて、良好な保護(少なくとも50%)から完全な保護が観察される: A-2、A-4、B-1、C-1、D-1、D-4、G-1、H-2、H-3、I-1、J-2、J-4、及び、K-1。

【0199】

これらの条件下、以下の化合物を110 ppmの薬量で用いて、良好な保護(少なくとも50%)から完全な保護が観察される: D-3、H-1、及び、J-1。

【0200】

これらの条件下、国際特許出願WO2004/074280に開示されている2,5-ジメチル-N-[2-(3,5,6-トリフルオロピリジン-2-イル)エチル]-3-フラミド; N-{2-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]エチル}-3-ヨード-4-(イソプロピルスルホニル)-5-(メチルチオ)チオフェン-2-カルボキサミド; N-{2-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]エチル}-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキサミド; N-{2-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]エチル}-4-メチル-2-フェニル-1,3-チアゾール-5-カルボキサミド; N-{2-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]エチル}-5-メチル-1-フェニル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド; N-{2-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]エチル}-5-メチル-3-フェニルイソキサゾール-4-カルボキサミド; 2-クロロ-N-[2-(5-クロロピリジン-2-イル)エチル]ニコチンアミド; 4-[(2-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]エチル)アミノ)カルボニル]ピペリジン-1-カルボン酸ベンジル; N-[2-(5-クロロ-3-フルオロピリジン-2-イル)エチル]-2-メチル-5,6-ジヒドロ-1,4-オキサチン-3-カルボキサミド; N-[2-(3,6-ジクロロピリジン-2-イル)エチル]-2-メチル-5,6-ジヒドロ-1,4-オキサチン-3-カルボキサミド(それぞれ、表Bの化合物B17、表Cの化合物C10、表Fの化合物F1、表Hの化合物H3、表Jの化合物J9、表Mの化合物M3、表Rの化合物R32、表Tの化合物T1、並びに、表Vの化合物V9及びV10)は、330 ppmで、アルテルナリア・ブラシカエ (*Alternaria brassicae*) 及びピレノホラ・テレス (*Pyrenophora teres*) に対して、効力を全く示さなかった。

【手続補正書】

【提出日】平成24年11月8日(2012.11.8)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

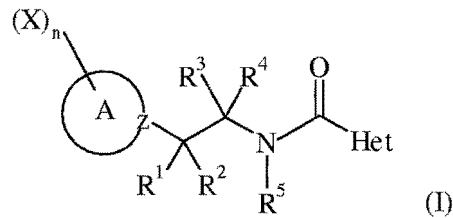
一般式(I)

10

20

30

## 【化 1】



[ 式中、

- ・ n は、1 又は 2 であり；
  - ・ A は、2 - チオフェン又は 4 - ピラゾールであり；
  - ・ z は、炭素原子（ここで、これには、X は置換することができない）であり；
  - ・ X は、同一であるか又は異なっていて、メチル基、ハロゲン原子、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - ハロゲノアルキルであり；
  - ・ R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> は、同一であるか又は異なっていて、水素原子であり；
  - ・ R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> は、同一であるか又は異なっていて、水素原子であり；
  - ・ R<sup>5</sup> は、水素原子であり；
  - ・ Het は、同一であっても又は異なっていてもよい 1 個又は 2 個のヘテロ原子を有する 5 員のヘテロ環であって、2 - フラン、3 - フラン、2 - チオフェン、3 - チオフェン、2 - ピロール、3 - ピロール、5 - チアゾール、4 - チアゾール、5 - ピラゾール、4 - ピラゾール、3 - ピラゾールを表し、ここで、Het は、炭素原子で結合しており、また、Het は、少なくともオルト位が置換されており、その際、置換基は、互いに独立して、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキル、1 ~ 5 個のフッ素原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - フルオロアルキルであるように選択される ]
- で表される化合物、又はその塩若しくは光学活性異性体。

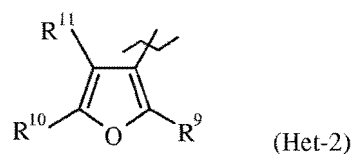
【請求項 2】

X が、ハロゲン原子であるように選択されることを特徴とする、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

Het が、  
一般式 (Het - 2)

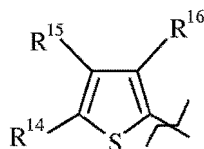
【化 2】



[ 式中、

- ・ R<sup>9</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る；
  - 及び、
  - ・ R<sup>10</sup> 及び R<sup>11</sup> は、同一であっても又は異なっていてもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、アミノ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る；
- 但し、R<sup>9</sup> と R<sup>11</sup> が両方とも水素原子であることはない ] のヘテロ環；
- 一般式 (Het - 4)

## 【化3】



(Het-4)

[ 式中、

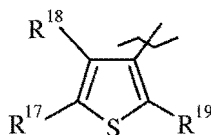
・ R<sup>14</sup> 及び R<sup>15</sup> は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルチオ又は C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルスルホニルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルで場合により置換されていてもよいピリジルであり得る；

及び、

・ R<sup>16</sup> は、ハロゲン原子、シアノ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルコキシであり得る ] のヘテロ環；

一般式 (Het - 5)

## 【化4】



(Het-5)

[ 式中、

・ R<sup>17</sup> 及び R<sup>18</sup> は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルオキシ又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る；

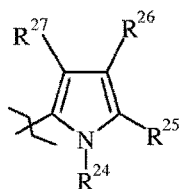
及び、

・ R<sup>19</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルであり得る；

但し、R<sup>18</sup> と R<sup>19</sup> が両方とも水素原子であることはない ] のヘテロ環；

一般式 (Het - 7)

## 【化5】



(Het-7)

[ 式中、

・ R<sup>24</sup> は、水素原子、シアノ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、ヒドロキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルスルホニル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル) アミノスルホニル又は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルスルホニルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルで場合により置換されていてもよいベンゾイルであり得る；

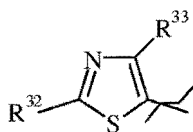
及び、

・  $R^{25}$ 、 $R^{26}$  及び  $R^{27}$  は、同一であっても又は異なってもよく、そして、それらは、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 - C_4$ -アルキル、1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキル又は  $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニルであり得る；

但し、 $R^{24}$  と  $R^{27}$  が両方とも水素原子であることはない] のヘテロ環；

一般式 (Het-10)

【化6】



(Het-10)

[ 式中、

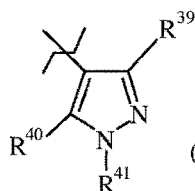
・  $R^{32}$  は、水素原子、ハロゲン原子、アミノ基、シアノ基、 $C_1 - C_4$ -アルキルアミノ、ジ- ( $C_1 - C_4$ -アルキル)アミノ、 $C_1 - C_4$ -アルキル又は1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルであり得るか、又は、ハロゲン原子若しくは  $C_1 - C_4$ -アルキルで場合により置換されていてもよいフェニルであり得る；

及び、

・  $R^{33}$  は、ハロゲン原子、 $C_1 - C_4$ -アルキル又は1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルであり得る] のヘテロ環；

一般式 (Het-13)

【化7】



(Het-13)

[ 式中、

・  $R^{39}$  は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1 - C_4$ -アルキル、1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルチオ、アミノカルボニル又はアミノカルボニル- $C_1 - C_4$ -アルキルであり得る；

・  $R^{40}$  は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルコキシ又は  $C_1 - C_4$ -アルキルチオであり得る；

及び、

・  $R^{41}$  は、水素原子、 $C_1 - C_4$ -アルキル、1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキル、ヒドロキシ- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ- $C_1 - C_4$ -アルキル、1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルチオ- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ- $C_1 - C_4$ -アルキル又は1～5個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルコキシ- $C_1 - C_4$ -アルキルであり得るか、又は、ハロゲン原子、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシアルキル若しくはニトロ基で場合により置換されていてもよいフェニルであり得る；

但し、 $R^{39}$  と  $R^{40}$  が両方とも水素原子であることはない] のヘテロ環

であるように選択されることを特徴とする、請求項1又は2に記載の化合物。

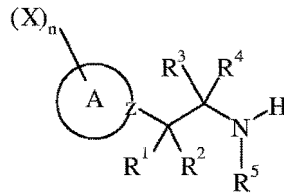
【請求項4】

A がオルト位で置換されていることを特徴とする、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 5】

請求項 1 で定義されている一般式 (I) で表される化合物を調製する方法であって、一般式 (II) である。

【化 8】

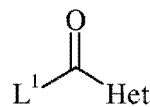


(II)

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

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

【化 9】

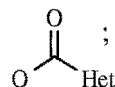


(III)

[式中、

- ・ Het は、請求項 1 で定義されているとおりであり；
- ・ L<sup>1</sup> は、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、-OR<sup>1 2 4</sup>又は-OCOR<sup>1 2 4</sup>であるように選択される脱離基であり、ここで、R<sup>1 2 4</sup>は、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ハロアルキル、ベンジル、4-メトキシベンジル、ペンタフルオロフェニル又は式

【化 10】



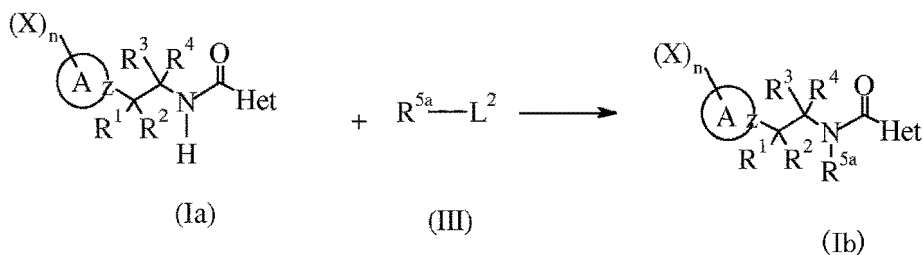
で表される基である]

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

【請求項 6】

下記的一般式 (Ia) で表される化合物を、一般式 (III) で表される化合物と反応させて一般式 (Ib) で表される化合物を生成させることを含む以下の反応スキーム：

【化 11】



(Ia)

(III)

(Ib)

[ここで、

- ・ A、X、n、z、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びHetは、請求項 1 で定義されているとおりであり；

- ・ R<sup>5a</sup>は、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル又はC<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-シクロアルキルであり；

・  $L^2$  は、ハロゲン原子、4 - メチルフェニルスルホニルオキシ又はメチルスルホニルオキシであるように選択される脱離基である ]  
に従う工程を有することを特徴とする、一般式 ( I b ) で表される化合物の調製方法。

【請求項 7】

有効量の請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物及び農業上許容される支持体を含む、殺菌剤組成物。

【請求項 8】

作物の植物病原性菌類と予防的又は治療的に闘う方法であって、有効で且つ植物に対して毒性を示さない量の請求項 7 に記載の組成物を、植物の種子、又は、植物の葉及び / 若しくは植物の果実、又は、植物がそこで生育している土壌若しくは植物をそこで栽培するのが望ましい土壌に施用することを特徴とする、前記方法。



## フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	テーマコード(参考)
C 0 7 D 409/12	(2006.01)	C 0 7 D 409/12	
C 0 7 D 417/12	(2006.01)	C 0 7 D 417/12	
C 0 7 D 401/12	(2006.01)	C 0 7 D 401/12	
C 0 7 D 411/12	(2006.01)	C 0 7 D 411/12	
C 0 7 D 405/12	(2006.01)	C 0 7 D 405/12	
C 0 7 D 403/12	(2006.01)	C 0 7 D 403/12	
C 0 7 B 61/00	(2006.01)	C 0 7 B 61/00	3 0 0

- (72)発明者 ハイコー・リーク  
フランス国、エフ - 6 9 1 1 0 ・サント・ホワイ・レ・リヨン、アレ・ビュフオン、2 9
- (72)発明者 ピエール・イブ・コクロン  
フランス国、エフ - 6 9 0 0 3 ・リヨン、クール・ドウ・ラ・リベルテ、5 6
- (72)発明者 フィリップ・デボルド  
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 アラン・ピリエ  
フランス国、エフ - 6 9 4 5 0 ・サン・シール・オ・モン・ドール、レ・テール・ドウ・トゥール  
ベオン - バティマン・アー
- (72)発明者 マリ・クレール・グロジャン - クールノワイエ  
フランス国、エフ - 6 9 2 5 0 ・キュリ・オ・モン・ドール、ルート・ダルビニー、ル・トレーブ  
・コロージュ
- (72)発明者 ピエール・ジュニクス  
フランス国、エフ - 6 9 0 0 4 ・リヨン、リュ・ドユビアル、1 4

F ターム(参考) 4C023 HA01 HA02  
4C063 AA01 BB09 CC22 CC62 CC75 CC87 CC92 DD04 DD12 DD22  
DD75 EE03  
4H011 AA01 BA01 BB08 BB09 BB10 BC18 DA15 DC05 DD03  
4H039 CA71 CL25

【外国語明細書】

2013049692000001.pdf