

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第6816110号
(P6816110)

(45) 発行日 令和3年1月20日(2021.1.20)

(24) 登録日 令和2年12月25日(2020.12.25)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 471/04	(2006.01)	C O 7 D 471/04	1 O 6 A
A O 1 P 3/00	(2006.01)	C O 7 D 471/04	C S P
A O 1 N 43/90	(2006.01)	C O 7 D 471/04	1 O 8 Q
C O 7 D 217/24	(2006.01)	A O 1 P 3/00	
		A O 1 N 43/90	1 O 3

請求項の数 14 (全 108 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2018-506935 (P2018-506935)
 (86) (22) 出願日 平成28年8月8日 (2016.8.8)
 (65) 公表番号 特表2018-525392 (P2018-525392A)
 (43) 公表日 平成30年9月6日 (2018.9.6)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2016/068890
 (87) 国際公開番号 W02017/025510
 (87) 国際公開日 平成29年2月16日 (2017.2.16)
 審査請求日 令和1年8月6日 (2019.8.6)
 (31) 優先権主張番号 15180771.6
 (32) 優先日 平成27年8月12日 (2015.8.12)
 (33) 優先権主張国・地域又は機関
 欧州特許庁 (EP)

(73) 特許権者 300091441
 シンジェンタ パーティシペーションズ
 アーゲー
 スイス国4058 バーゼル、シュバルツ
 バルトアレー 215
 (74) 代理人 100094569
 弁理士 田中 伸一郎
 (74) 代理人 100088694
 弁理士 弟子丸 健
 (74) 代理人 100103610
 弁理士 ▲吉▼田 和彦
 (74) 代理人 100084663
 弁理士 箱田 篤
 (74) 代理人 100093300
 弁理士 浅井 賢治

最終頁に続く

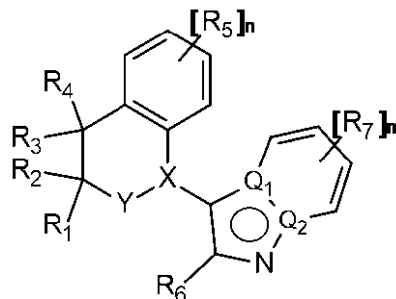
(54) 【発明の名称】 殺微生物二環式複素環式誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



(I)

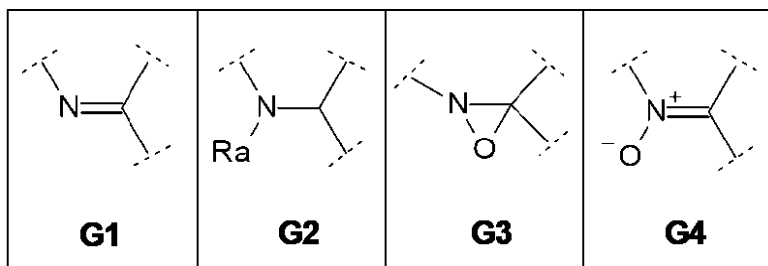
(式中、

Q₁は窒素原子であり、および、Q₂は炭素原子であるか；または

Q₁は炭素原子であり、および、Q₂は窒素原子であり；

Y - Xは、G1、G2、G3、およびG4から選択される基を表し：

【化2】



R_1 および R_2 は各々、水素、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、および $C_2 \sim C_6$ アルキニルから独立して選択され、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、およびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよい；または

10

R_1 および R_2 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル基（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよい）を表し；

R_3 および R_4 は各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、および $C_2 \sim C_6$ アルキニルから独立して選択され、ここで、前記アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アルケニル、およびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよい；または

20

R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ 、 $C=NOR_d$ 、 $C=C(R_b)(R_c)$ 、または $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよい）を表し；式中、 R_b および R_c は各々、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択され、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、およびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよく、かつ、 R_d は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、および $C_3 \sim C_6$ アルキニルから独立して選択され、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、およびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよく；あるいは

30

R_2 および R_3 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよく、さらに、環炭素単位は、酸素または硫黄原子により置き換えられてもよい）を表し；

各 R_5 は独立して、ハロゲン、ヒドロキシル、メルカプト、ニトロ、シアノ、ホルミル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $-C(=NOR_a)C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、アリール、ヘテロアリール、アリールオキシ、またはヘテロアリールオキシを表し、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アリール、およびヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、シアノ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～5個の置換基で任意に置換されてもよく； n は、0、1、2、3、または4であり；

40

R_6 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、またはヒドロキシ

50

ルであり；

各 R_7 は独立して、ヒドロキシル、メルカプト、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、または $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシを表し； m は、0、1、2、3 または 4 であり；

R_a は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、およびフェノキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよい)

の化合物、または、その塩もしくは N - オキシド。

10

【請求項 2】

R_1 および R_2 が各々、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、前記アルキルおよびシクロアルキル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよいか；または、

R_1 および R_2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよい）を表す、請求項 1 に記載の化合物。

20

【請求項 3】

R_3 および R_4 が各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、前記アルキル、アルコキシ、およびシクロアルキル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよいか；または、 R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C = O$ 、 $C = NOR_d$ 、 $C = C(R_b)(R_c)$ または $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよい）を表し、式中、 R_b および R_c は各々、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択され、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、およびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよく、 R_d は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、および $C_3 \sim C_6$ アルキニルから選択され、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、およびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよく；あるいは、 R_2 および R_3 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよく、さらに、環炭素単位は、酸素または硫黄原子により置き換えられてもよい）を表す、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

30

40

【請求項 4】

各 R_5 が独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $-C(=NOR_a)C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、ヘテロアリール（ここで、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリル、またはオキサゾリルである）、フェノキシ、またはヘテロアリーロキシ（ここで、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリル、またはオキサゾリルである

50

)を表し、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、フェニル、およびヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、シアノ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～5個の置換基で任意に置換されてもよく； n が、0、1、2、3、または4である、請求項1、2、または3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項5】

R_6 が、水素、ハロゲン、または $C_1 \sim C_2$ アルキルである、請求項1、2、3、または4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

各 R_7 が独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、または $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシであり； m が、0、1、2、3、または4である、請求項1、2、3、4、または5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項7】

$Y - X$ が、 G_1 を表す、請求項1、2、3、4、5、または6のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項8】

$Y - X$ が、前記基 G_1 を表し； R_1 および R_2 が各々、独立して、水素または $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり、ここで、前記アルキル基は、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよい；または、 R^1 および R^2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル基を表し； R_3 および R_4 が各々、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、および $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、前記アルキルおよびシクロアルキル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_3$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよい；または、 R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C = O$ 、 $C = NOR_d$ 、または $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_3$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよい）を表し、式中、 R_d は、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、および $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルから選択され、ここで、前記アルキルおよびシクロアルキル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_3$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよく；各 R_5 が独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、フェニル、ヘテロアリール（ここで、ヘテロアリールは、ピリジル、チアゾリル、またはオキサゾリルである）を表し、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、フェニル、およびヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、および $C_1 \sim C_3$ アルコキシから独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよく； n が、0、1、または2であり； R_6 が、水素、フルオロ、クロロ、またはメチルであり；各 R_7 が独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、または $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し； m が、0、1、または2である、請求項1に記載の化合物、または、その塩もしくは $N -$ オキシド。

【請求項9】

$Y - X$ が、前記基 G_1 を表し； R_1 および R_2 が各々、独立して、 $C_1 \sim C_3$ アルキルであるか；または、 R_1 および R_2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル基を表し； R_3 および R_4 が各々、水素、ハロゲン、および $C_1 \sim C_4$ アルキルから独立して選択されるか；または、 R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C = O$ または $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し；各 R_5 が独立して、

ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し； n が、0、1、または2であり； R_6 が、水素、フルオロ、クロロ、またはメチルであり；各 R_7 が独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、または $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し； m が、0、1、または2である、請求項1に記載の化合物、または、その塩もしくはN - オキシド。

【請求項10】

Y - Xが、前記基G1を表し； R_1 および R_2 が各々、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキル基であり； R_3 および R_4 が各々、水素、フルオロ、および $C_1 \sim C_2$ アルキルから独立して選択されるか；または、 R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し；各 R_5 が独立して、フルオロ、クロロ、ブromo、シアノ、または $C_1 \sim C_2$ アルキルを表し； n が、0、1、または2であり； R_6 が、水素であり；各 R_7 が独立して、フルオロ、クロロ、または $C_1 \sim C_3$ アルキルを表し； m が、1または2である、請求項1に記載の化合物、または、その塩もしくはN - オキシド。

10

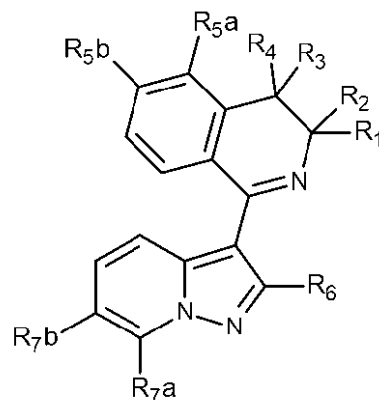
【請求項11】

Q_1 が、炭素原子であり、 Q_2 が、窒素原子である、請求項1、2、3、4、5、6、7、8、9、または10のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項12】

前記化合物が、式(IK)：

【化3】



(IK)

20

30

(式中、 R_1 は、メチルであり； R_2 は、メチルであり； R_3 は、メチルまたはフルオロであり； R_4 は、メチルまたはフルオロであり； R_5a は、フルオロまたは水素であり； R_5b は、フルオロまたは水素であり； R_6 は、水素であり； R_7a は、メチルまたは水素であり； R_7b は、メチル、フルオロ、または水素であるか；または、式中、 R_1 は、メチルであり、 R_2 は、メチルであり、 R_6 は、水素であり、かつ、 R_3 、 R_4 、 R_5a 、 R_5b 、 R_7a 、および R_7b は、以下に定義されているとおりである)：

【表 1】

化合物	R ₃	R ₄	R _{5a}	R _{5b}	R _{7a}	R _{7b}
IK-1	メチル	メチル	フルオロ	水素	メチル	メチル
IK-2	フルオロ	フルオロ	フルオロ	水素	メチル	メチル
IK-3	フルオロ	フルオロ	水素	フルオロ	メチル	メチル
IK-4	フルオロ	フルオロ	水素	水素	メチル	メチル
IK-5	フルオロ	フルオロ	水素	水素	メチル	フルオロ
IK-6	フルオロ	フルオロ	水素	水素	メチル	水素
IK-7	フルオロ	フルオロ	水素	水素	水素	メチル
IK-8	メチル	メチル	フルオロ	水素	メチル	水素
IK-9	フルオロ	フルオロ	水素	フルオロ	メチル	水素
IK-10	フルオロ	フルオロ	水素	フルオロ	水素	メチル

10

の化合物である、請求項 1 に記載の化合物、または、その塩もしくは N - オキシド。

【請求項 1 3】

殺菌・殺カビ的に有効な量の請求項 1 ~ 1 2 のいずれかに記載されている式 (I) の化合物を含み、任意で希釈剤および / またはさらなる活性成分を含む、組成物。

20

【請求項 1 4】

植物病原性病害の駆除、予防、または防除方法であって、植物病原体、植物病原体の生息地、または、植物病原体による被害を受けやすい植物、または、その繁殖体に、殺菌・殺カビ的に有効な量の請求項 1 ~ 1 2 のいずれかに定義されている式 (I) の化合物、または、殺菌・殺カビ的に有効な量の請求項 1 ~ 1 2 のいずれかに定義されている式 (I) の化合物を含む組成物、または、請求項 1 3 に定義されている組成物を適用する工程を含むことを特徴とする方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

30

本発明は、例えば、特に殺菌・殺カビ (fungicidal) 活性といった殺微生物活性を有する活性成分としての殺微生物二環式複素環式誘導体に関する。本発明はまた、これらの二環式複素環式誘導体の調製、これらの二環式複素環式誘導体の調製に有用な中間体、これらの中間体の調製、少なくとも 1 種の二環式複素環式誘導体を含む農芸化学組成物、これらの組成物の調製、および、農業または園芸における、植物、収穫された食品作物、種子または非生体材料に対する特に真菌といった植物病原性微生物による外寄生を防除もしくは予防するための二環式複素環式誘導体または組成物の使用に関する。

【背景技術】

【0002】

ある殺菌・殺カビヘテロ二環式化合物が国際公開第 0 5 0 7 0 9 1 7 号に記載されている。

40

【発明の概要】

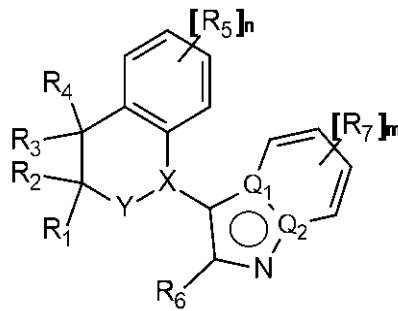
【0003】

ここでは、一定の新規な二環式複素環式誘導体が好ましい殺菌・殺カビ特性を有することが意外なことに見出された。

【0004】

本発明は従って、式 I の化合物

【化1】



(I)

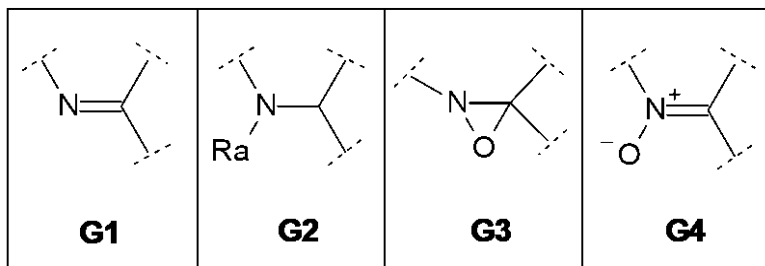
10

(式中、

Q₁は窒素原子であり、および、Q₂は炭素原子であるか；またはQ₁は炭素原子であり、および、Q₂は窒素原子であり；

Y - Xは、G1、G2、G3およびG4から選択されるラジカルを表し；

【化2】



20

R₁およびR₂は各々、水素、シアノ、C₁~C₆アルキル、C₃~C₇シクロアルキル、C₂~C₆アルケニルおよびC₂~C₆アルキニルから独立して選択され、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、任意選択により、ハロゲン、C₁~C₆アルコキシおよびC₁~C₆アルキルチオから独立して選択される1~3個の置換基で置換され得；または

R₁およびR₂は、これらが結合している炭素原子と一緒に、C₃~C₁₀シクロアルキル基（これは、任意選択により、ハロゲン、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコキシおよびC₁~C₆アルキルチオからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換され得る）を表し；

30

R₃およびR₄は各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₃~C₇シクロアルキル、C₂~C₆アルケニルおよびC₂~C₆アルキニルから独立して選択され、ここで、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、任意選択により、ハロゲン、C₁~C₆アルコキシおよびC₁~C₆アルキルチオから独立して選択される1~3個の置換基で置換され得；または

R₃およびR₄は、これらが結合している炭素原子と一緒に、C=O、C=NOR_d、C=C(R_b)(R_c)またはC₃~C₁₀シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲン、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコキシおよびC₁~C₆アルキルチオからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換され得る）を表し；式中、R_bおよびR_cは各々、水素、ハロゲン、シアノ、C₁~C₆アルキル、C₃~C₇シクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₁~C₆アルコキシおよびC₁~C₆アルキルチオから独立して選択され、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、任意選択により、ハロゲン、C₁~C₆アルコキシおよびC₁~C₆アルキルチオから独立して選択される1~3個の置換基で置換され得、および、式中、R_dは、水素、C₁~C₆アルキル、C₃~C₇シクロアルキル、C₃~C₆アルケニルおよびC₃~C₆アルキニルから選択され、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、任意選択により、ハロゲン、C₁~C₆アルコキシおよびC₁~C₆アルキルチオから独立して選択される1~3個の置換基で置換され得；または

40

50

R_2 および R_3 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換され得、かつ、さらに、環炭素単位は、酸素または硫黄原子により置き換えられ得る）を表し；

各 R_5 は独立して、ハロゲン、ヒドロキシル、メルカプト、ニトロ、シアノ、ホルミル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $-C(=NOR_a)$ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、アリール、ヘテロアリール、アリールオキシまたはヘテロアリールオキシを表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アリールおよびヘテロアリール基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、シアノおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～5個の置換基で置換され得； n は、0、1、2、3または4であり；

R_6 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシまたはヒドロキシルであり；

各 R_7 は独立して、ヒドロキシル、メルカプト、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシまたは $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシを表し； m は、0、1、2、3または4であり；ならびに

R_a は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオおよびフェノキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換され得る）または、その塩もしくはN-オキsidを提供する。

【発明を実施するための形態】

【0005】

第2の態様において、本発明は、式(I)の化合物を含む農芸化学組成物を提供する。

【0006】

式(I)の化合物は植物病原性微生物の防除に用いられ得る。それ故、植物病原体を防除するために、本発明に係る式(I)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物は、植物病原体に直接、または、植物病原体の生息地（特に植物病原体による被害を受けやすい植物）に適用され得る。

【0007】

それ故、第3の態様において、本発明は、植物病原体を防除するための本明細書に記載の式(I)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物の使用を提供する。

【0008】

さらなる態様において、本発明は、本明細書に記載の式(I)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物を、前記植物病原体、または、前記植物病原体の生息地（特に植物病原体による被害を受けやすい植物）に適用するステップを含む植物病原体の防除方法を提供する。

【0009】

式(I)の化合物は、植物病原性真菌の防除に特に効果的である。

【0010】

それ故、さらなる態様において、本発明は、植物病原性真菌を防除するための本明細書に記載の式(I)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物の使用を提供する。

【0011】

さらなる態様において、本発明は、本明細書に記載の式(I)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物を、前記植物病原性真菌、または、前記植物病原性真菌の生息地（

10

20

30

40

50

特に植物病原性真菌による被害を受けやすい植物)に適用するステップを含む植物病原性真菌の防除方法を提供する。

【0012】

置換基が任意選択により置換されていると示されている場合、これは、これらの置換基が、1個以上の同等もしくは異なる置換基、例えば1～3個の置換基を有していてもいなくてもよいことを意味する。通常、3個以下のこのような任意選択の置換基が同時に存在する。1個の基が置換されていると示されている場合(例えばアルキル)、これは、他の基の一部であるこれらの基を含む(例えばアルキルチオ中のアルキル)。

【0013】

「ハロゲン」という用語は、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を指し、好ましくはフッ素、塩素または臭素を指す。

10

【0014】

アルキル置換基は直鎖または分岐であり得る。アルキルは、それ自体、または、他の置換基の一部として、記載されている炭素原子の数に応じて、例えば、メチル、エチル、*n*-プロピル、*n*-ブチル、*n*-ペンチル、*n*-ヘキシルおよびこれらの異性体、例えば、イソ-プロピル、イソ-ブチル、*sec*-ブチル、*t*-ブチルまたはイソ-アミルである。

【0015】

アルケニル置換基(単独で、または、例えばアルケニルオキシなどのより大きな基の一部として)は直鎖または分岐鎖の形態であることが可能であり、このアルケニル部分は、適切な場合、(E)-または(Z)-立体構成のものであることが可能である。例はビニルおよびアリルである。アルケニル基は、好ましくはC₂~C₆、より好ましくはC₂~C₄、および、最も好ましくはC₂~C₃アルケニル基である。

20

【0016】

アルキニル置換基(単独で、または、例えばアルキニルオキシなどのより大きな基の一部として)は、直鎖または分岐鎖の形態であることが可能である。例はエチニルおよびプロパルギルである。アルキニル基は、好ましくはC₂~C₆、より好ましくはC₂~C₄、および、最も好ましくはC₂~C₃アルキニル基である。

【0017】

ハロアルキル基(単独で、または、例えばハロアルキルオキシなどのより大きな基の一部として)は1個以上の同等または異なるハロゲン原子を含有し得、例えば、CH₂Cl、CHCl₂、CCl₃、CH₂F、CHF₂、CF₃、CF₃CH₂、CH₃CF₂、CF₃CF₂またはCCl₃CCl₂を表し得る。

30

【0018】

ハロアルケニル基(単独で、または、例えばハロアルケニルオキシなどのより大きな基の一部として)はそれぞれアルケニル基であり、これらは、1つ以上の同一または異なるハロゲン原子で置換されており、例えば、2,2-ジフルオロビニルまたは1,2-ジクロロ-2-フルオロ-ビニルである。

【0019】

ハロアルキニル基(単独で、または、例えばハロアルキニルオキシなどのより大きな基の一部として)はそれぞれアルキニル基であり、これらは、1つ以上の同一または異なるハロゲン原子で置換されており、例えば1-クロロ-プロポ-2-イニルである。

40

【0020】

アルコキシはラジカル-ORを意味し、式中、例えば上記に定義されているとおり、Rはアルキルである。アルコキシ基としては、これらに限定されないが、メトキシ、エトキシ、1-メチルエトキシ、プロポキシ、ブトキシ、1-メチルプロポキシおよび2-メチルプロポキシが挙げられる。

【0021】

シアノは-CN基を意味する。

【0022】

50

アミノは -NH₂基を意味する。

【0023】

ヒドロキシルまたはヒドロキシは、-OH基を指す。

【0024】

アリール基（単独で、または、例えばアリールオキシ、アリール-アルキルなどのより大きな基の一部として）は、単環式、二環式または三環式の形態であることが可能である芳香族環系である。このような環の例としては、フェニル、ナフチル、アントラセニル、インデニルまたはフェナントレニルが挙げられる。好ましいアリール基はフェニルおよびナフチルであり、フェニルが最も好ましい。アリール部分が置換されていると言われる場合、このアリール部分は、好ましくは1~4個の置換基、最も好ましくは1~3個の置換基で置換されている。

10

【0025】

ヘテロアリール基（単独で、または、例えばヘテロアリールオキシ、ヘテロアリール-アルキルなどのより大きな基の一部として）は、少なくとも1個のヘテロ原子を含有すると共に、単一の環または2つ以上の縮合環から構成される芳香族環系である。好ましくは、単一の環は3個以下のヘテロ原子を含有し、二環系は4個以下のヘテロ原子を含有することとなり、これらは、窒素、酸素および硫黄から好ましく選択されることとなる。単環式基の例としては、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル（例えば[1,2,4]トリアゾリル）、フラニル、チオフェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、チアゾリル、イソチアゾリルおよびチアジアゾリルが挙げられる。二環式基の例としては、プリニル、キノリニル、シノリニル、キノキサリニル、インドリル、インダゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾチオフェニルおよびベンゾチアゾリルが挙げられる。単環式ヘテロアリール基が好ましく、ピリジルが最も好ましい。ヘテロアリール部分が置換されていると言われる場合、このヘテロアリール部分は、好ましくは1~4個の置換基、最も好ましくは1~3個の置換基で置換されている。

20

【0026】

ヘテロシクリル基または複素環（単独で、または、ヘテロシクリル-アルキルなどのより大きな基の一部として）は、O、SおよびNから選択される1個以上（好ましくは1個、2個または3個）のヘテロ原子を含む10個以下の原子を含有する非芳香族環構造である。単環式基の例としては、オキセタニル、4,5-ジヒドロ-イソオキサゾリル、チエタニル、ピロリジニル、テトラヒドロフラニル、[1,3]ジオキサニル、ピペリジニル、ピペラジニル、[1,4]ジオキサニル、イミダゾリジニル、[1,3,5]オキサジアジナニル、ヘキサヒドロ-ピリミジニル、[1,3,5]トリアジナニルおよびモルホリニル、または、1-オキソ-チエタニルおよび1,1-ジオキソ-チエタニルなどのこれらの酸化型が挙げられる。二環式基の例としては、2,3-ジヒドロ-ベンゾフラニル、ベンゾ[1,4]ジオキサニル、ベンゾ[1,3]ジオキサニル、クロメニルおよび2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]ジオキシニルが挙げられる。ヘテロシクリル部分が置換されていると言われる場合、このヘテロシクリル部分は、好ましくは1~4個の置換基、最も好ましくは1~3個の置換基で置換されている。

30

40

【0027】

式(I)の化合物中に1個以上の不斉炭素原子の存在が可能であるとは、その化合物が光学異性形態、すなわち、鏡像異性形態またはジアステレオ異性形態をとり得ることを意味する。また、単結合に係る回転の制限によってアストロブ異性体が生じ得る。式(I)は、すべてのこれらの可能性のある異性形態およびその混合物を含むことが意図されている。本発明は、式(I)の化合物に係るすべてのこれらの可能性のある異性形態およびその混合物を含む。同様に、式(I)は、すべての可能性のある互変異性体を含むことが意図されている。本発明は、式(I)の化合物に係るすべての可能性のある互変異性形態を含む。

【0028】

50

各事例において、本発明に係る式 (I) の化合物は、遊離形態、N - オキシドとしての酸化型、または、例えば農業経済学的に使用可能な塩形態といった塩形態である。

【0029】

N - オキシドは、第三級アミンの酸化型、または、窒素含有芳香族複素環式化合物の酸化型である。これらは、例えば、書籍“Heterocyclic N - oxides”, A. Albini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991に記載されている。

【0030】

Y - X、R₁、R₂、R₃、R₄、R_b、R_c、R_d、R₅、R₆、R₇、R_a、m、n、Q₁およびQ₂の好ましい値は、任意のこれらの組み合わせで、以下に規定されているとおりである；

好ましくは、Y - XはラジカルG1を表す。

【0031】

好ましくは、R₁およびR₂は各々、水素、C₁~C₆アルキル、C₃~C₇シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、C₁~C₆アルコキシおよびC₁~C₆アルキルチオから独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく；または、R₁およびR₂は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、C₃~C₆シクロアルキル基（これは、任意選択により、ハロゲン、C₁~C₆アルキルおよびC₁~C₆アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい）を表す。

【0032】

より好ましくは、R₁およびR₂は各々、独立して、水素またはC₁~C₄アルキル基であり、ここで、アルキル基は、任意選択により、ハロゲンおよびC₁~C₆アルコキシから独立して選択される1~3個の置換基で置換され得；または、R¹およびR²は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、C₃~C₅シクロアルキル基を表す。

【0033】

さらに好ましくは、R₁およびR₂は各々、独立して、C₁~C₃アルキルであり；または、R₁およびR₂は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、C₃~C₄シクロアルキル基を表す。

【0034】

最も好ましくは、R₁およびR₂は各々、独立して、C₁~C₂アルキル基である（特に最も好ましいのは、共にメチルの場合である）。

【0035】

好ましくは、R₃およびR₄は各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコキシおよびC₃~C₇シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキル、アルコキシおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、C₁~C₆アルコキシおよびC₁~C₆アルキルチオから独立して選択される1~3個の置換基で置換され得；または、R₃およびR₄は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、C=O、C=NOR_d、C=C(R_b)(R_c)またはC₃~C₆シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲン、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコキシおよびC₁~C₆アルキルチオからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換され得る）を表し、式中、R_bおよびR_cは各々、水素、ハロゲン、シアノ、C₁~C₆アルキル、C₃~C₇シクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₁~C₆アルコキシおよびC₁~C₆アルキルチオから独立して選択され、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、任意選択により、ハロゲン、C₁~C₆アルコキシおよびC₁~C₆アルキルチオから独立して選択される1~3個の置換基で置換され得、および、式中、R_dは、水素、C₁~C₆アルキル、C₃~C₇シクロアルキル、C₃~C₆アルケニルおよびC₃~C₆アルキニルから選択され、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、任意選択により、ハロゲン、C₁~C₆アルコキシおよびC₁~C₆アルキルチオから独立して選択される1~3個の置換基で置換され得；または、R₂およびR₃は、

これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換され得、かつ、さらに、環炭素単位は、酸素または硫黄原子により置き換えられ得る）を表す。

【0036】

より好ましくは、 R_3 および R_4 は各々、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルおよび $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換され得；または、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ 、 $C=NOR_d$ または $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換され得る）を表し、式中、 R_d は、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキルおよび $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルから選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ（好ましくは、 R_d は水素および $C_1 \sim C_3$ アルキルから選択され、ここで、アルキル基は、任意選択により、1～3個のハロゲン原子（好ましくはフッ素原子）で置換され得る）から独立して選択される1～3個の置換基で置換され得る。

10

【0037】

さらにより好ましくは、 R_3 および R_4 は各々、水素、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_4$ アルキルから独立して選択され（特に最も好ましいのは、共にメチルであるか、または共にフルオロである場合であり）；または、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ または $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表す。

20

【0038】

最も好ましくは、 R_3 および R_4 は各々、水素、フルオロおよび $C_1 \sim C_2$ アルキルから独立して選択され；または、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表す。

【0039】

好ましくは、各 R_5 は独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $-C(=NOR_a)C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、ヘテロアリアル（式中、ヘテロアリアルは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリアルオキシ（式中、ヘテロアリアルは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）を表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、フェニルおよびヘテロアリアル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、シアノおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～5個の置換基で置換されていてもよく； n は、0、1、2、3または4である。

30

【0040】

より好ましくは、各 R_5 は独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、フェニル、ヘテロアリアル（式中、ヘテロアリアルは、ピリジル、チアゾリルまたはオキサゾリルである）を表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、フェニルおよびヘテロアリアル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキルおよび $C_1 \sim C_3$ アルコキシから独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく； n は、0、1または2である。

40

【0041】

さらにより好ましくは、各 R_5 は独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し； n は、0、1または2である。

50

【 0 0 4 2 】

最も好ましくは、各 R_5 は独立して、フルオロ、クロロ、ブromo、シアノ、または $C_1 \sim C_2$ アルキルを表し（特に最も好ましいのは、フルオロまたはメチルであり）； n は、0、1 または 2（好ましくは 1）である。

【 0 0 4 3 】

好ましくは、 R_6 は、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである。

【 0 0 4 4 】

より好ましくは、 R_6 は、水素、フルオロ、クロロまたはメチルである。

【 0 0 4 5 】

最も好ましくは、 R_6 は水素である。

10

【 0 0 4 6 】

好ましくは、各 R_7 は独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシもしくは $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシであり； m は、0、1、2、3 もしくは 4 である。

【 0 0 4 7 】

より好ましくは、各 R_7 は独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオまたは $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し； m は 0、1 または 2 である。

20

【 0 0 4 8 】

さらにより好ましくは、各 R_7 は独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し； m は 0、1 または 2 である。

【 0 0 4 9 】

最も好ましくは、各 R_7 は独立して、フルオロ、クロロまたは $C_1 \sim C_3$ アルキルを表し； m は 1 または 2 である。

【 0 0 5 0 】

好ましくは、 R_a は水素または $C_1 \sim C_2$ アルキルである。

【 0 0 5 1 】

上記の採択は、 Q_1 が窒素原子であり、かつ、 Q_2 が炭素原子である場合と、および、 Q_1 が炭素原子であり、かつ、 Q_2 が窒素原子である場合との両方に適用される。

30

【 0 0 5 2 】

好ましくは、 Q_1 は炭素原子であり、および、 Q_2 は窒素原子である。

【 0 0 5 3 】

本発明に係る実施形態は以下に規定されているとおり提供される。

【 0 0 5 4 】

実施形態 1 は、上記に定義されているとおり、式 (I) の化合物およびその塩もしくは N - オキシドを提供する。

【 0 0 5 5 】

実施形態 2 は、実施形態 1 に記載の化合物を提供するものであり、式中、 R_1 および R_2 は各々、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換され得；または

40

R_1 および R_2 は、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルおよび $C_1 \sim C_6$ アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換され得る）を表す。

【 0 0 5 6 】

実施形態 3 は、実施形態 1 または 2 に記載の化合物を提供するものであり、式中、 R_3 および R_4 は各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコ

50

キシおよび $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキル、アルコキシおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換され得；または、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C = O$ 、 $C = NOR_d$ 、 $C = C(R_b)(R_c)$ または $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換され得る）を表し、式中、 R_b および R_c は各々、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択され、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換され得、および、式中、 R_d は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルおよび $C_3 \sim C_6$ アルキニルから選択され、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換され得；または、 R_2 および R_3 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換され得、かつ、さらに、環炭素単位は、酸素または硫黄原子により置き換えられ得る）を表す。

【0057】

実施形態 4 は、実施形態 1、2 または 3 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各 R_5 は独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $-C(=NOR_a)C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、ヘテロアリール（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリールオキシ（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）を表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、フェニルおよびヘテロアリール基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、シアノおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 5 個の置換基で置換され得； n は、0、1、2、3 または 4 である。

【0058】

実施形態 5 は、実施形態 1、2、3 または 4 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R_6 は、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである。

【0059】

実施形態 6 は、実施形態 1、2、3、4 または 5 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各 R_7 は独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシまたは $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシを表し； m は、0、1、2、3 または 4 である。

【0060】

実施形態 7 は、実施形態 1、2、3、4、5 または 6 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R_1 および R_2 は各々、独立して、水素または $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり、ここで、アルキル基は、任意選択により、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換され得；または、 R^1 および R^2 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル基を表す。

【0061】

実施形態 8 は、実施形態 1、2、3、4、5、6 または 7 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R_3 および R_4 は各々、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルおよび $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換され得；または、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ 、 $C=NOR_d$ または $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換され得る）を表し、式中、 R_d は、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキルおよび $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルから選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ（好ましくは、 R_d は水素および $C_1 \sim C_3$ アルキルから選択され、ここで、アルキル基は、任意選択により、1 ~ 3 個のハロゲン原子（好ましくはフッ素原子）で置換され得る）から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換され得る。

10

【0062】

実施形態 9 は、実施形態 1、2、3、4、5、6、7 または 8 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各 R_5 は独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、フェニル、ヘテロアリール（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チアゾリルまたはオキサゾリルである）を表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、フェニルおよびヘテロアリール基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキルおよび $C_1 \sim C_3$ アルコキシから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換され得； n は、0、1 または 2 である。

20

【0063】

実施形態 10 は、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8 または 9 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R_6 は、水素、フルオロ、クロロまたはメチルである。

【0064】

実施形態 11 は、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9 または 10 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各 R_7 は独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオまたは $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し； m は、0、1 または 2 である。

30

【0065】

実施形態 12 は、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10 または 11 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R_1 および R_2 は各々、独立して、 $C_1 \sim C_3$ アルキルであり；または、 R_1 および R_2 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル基を表す。

【0066】

実施形態 13 は、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11 または 12 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R_3 および R_4 は各々、水素、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_4$ アルキルから独立して選択され；または、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ または $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表す。

40

【0067】

実施形態 14 は、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12 または 13 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各 R_5 は独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し； n は、0、1 または 2 である。

【0068】

実施形態 15 は、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、

50

13または14のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R_6 は水素である。

【0069】

実施形態16は、実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14または15のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各 R_7 は独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し； m は、0、1または2である。

【0070】

実施形態17は、実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15または16のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R_1 および R_2 は各々、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキル基（好ましくは、共にメチル）である。

10

【0071】

実施形態18は、実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16または17のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R_3 および R_4 は各々、水素、フルオロおよび $C_1 \sim C_2$ アルキル（好ましくは、共にメチルであるか、または、共にフルオロである）から独立して選択され；または、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表す。

【0072】

実施形態19は、実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17または18のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各 R_5 は独立して、フルオロ、クロロ、プロモ、シアノまたは $C_1 \sim C_2$ アルキル（好ましくはフルオロ）を表し； n は、0、1または2（好ましくは0または1）である。

20

【0073】

実施形態20は、実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18または19のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各 R_7 は独立して、フルオロ、クロロまたは $C_1 \sim C_3$ アルキル（好ましくはフルオロまたはメチル）を表し； m は1または2である。

30

【0074】

実施形態21は、実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19または20のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $Y-X$ はラジカルG1を表す。

【0075】

実施形態22は、実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20または21のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 Q_1 は窒素原子であり、および、 Q_2 が炭素原子である場合。

【0076】

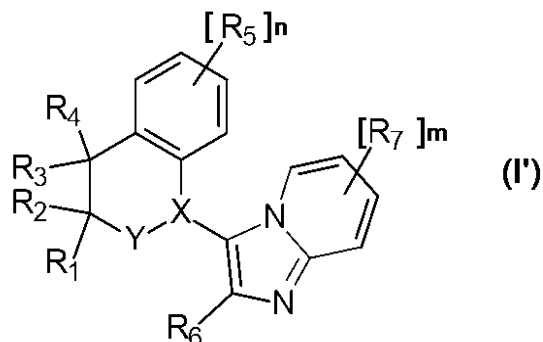
実施形態23は、実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20または21のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 Q_1 は炭素原子であり、および、 Q_2 は窒素原子である。

40

【0077】

本発明に係る化合物の一群は、式(I')のものであり、

【化3】



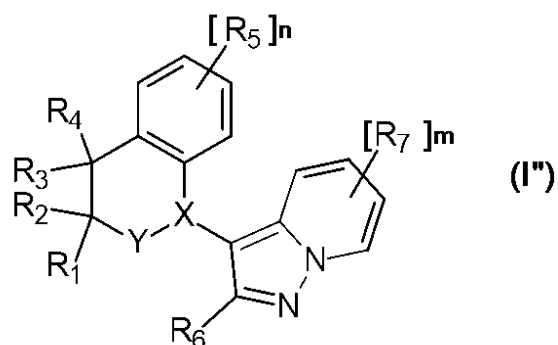
10

式中、Y - X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁷、mおよびnは、式(I)の化合物、または、その塩もしくはN - オキシドについて定義されているとおりである。Y - X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁷、mおよびnの好ましい定義は、式(I)の化合物について定義されているとおりである。

【0078】

本発明に係る化合物の他の群は、式(I'')のものであり、

【化4】



20

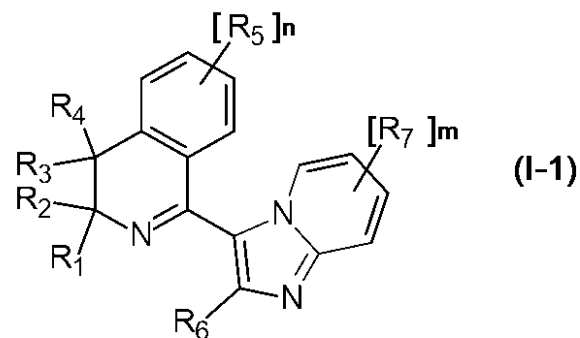
式中、Y - X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、mおよびnは、式(I)の化合物、または、その塩もしくはN - オキシドについて定義されているとおりである。Y - X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、mおよびnの好ましい定義は、式(I)の化合物について定義されているとおりである。

30

【0079】

本発明に係る化合物の好ましい群は、式(I-1)のものであり、

【化5】



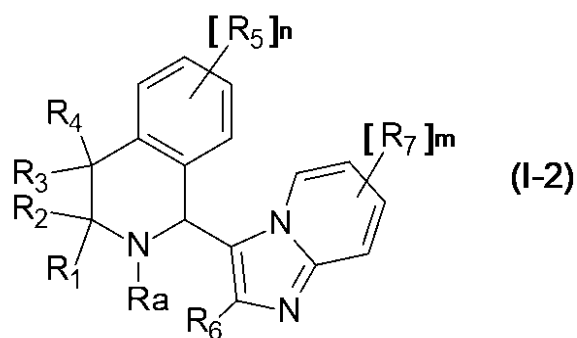
40

式中、A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁷、mおよびnは、式(I)の化合物、または、その塩もしくはN - オキシドについて定義されているとおりである。R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁷、mおよびnの好ましい定義は、式(I)の化合物について定義されているとおりである。

【0080】

50

本発明に係る化合物の他の好ましい群は、式 (I - 2) のものであり、
【化 6】

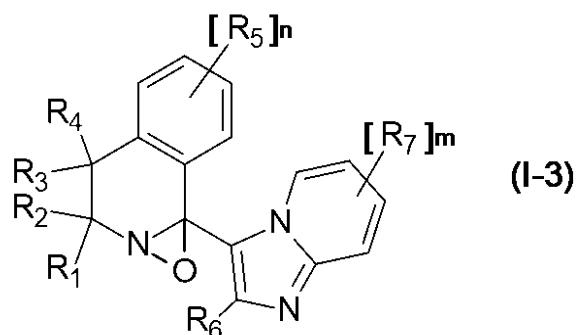


10

式中、A、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^7 、 R_a 、 m および n は式 (I) の化合物、または、その塩もしくはN - オキッドについて定義されているとおりである。 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^7 、 R_a 、 m および n の好ましい定義は、式 (I) の化合物について定義されているとおりである。

【0081】

本発明に係る化合物の他の好ましい群は、式 (I - 3) のものであり、
【化 7】



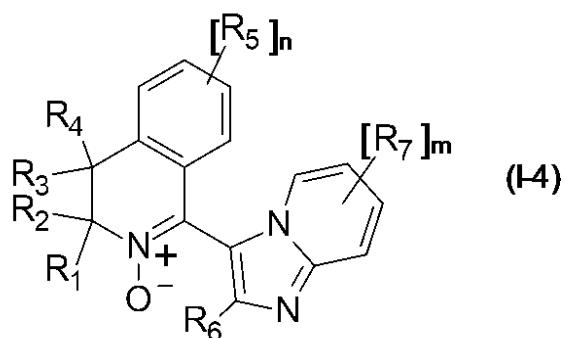
20

式中、A、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^7 、 m および n は、式 (I) の化合物、または、その塩もしくはN - オキッドについて定義されているとおりである。 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^7 、 m および n の好ましい定義は、式 (I) の化合物について定義されているとおりである。

30

【0082】

本発明に係る化合物の他の好ましい群は式 (I - 4) のものであり、
【化 8】



40

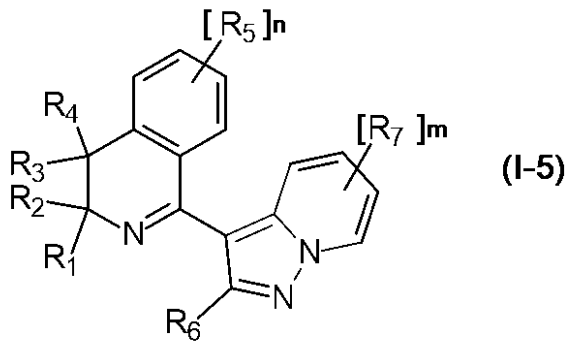
式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 m および n は、式 (I) の化合物、または、その塩もしくはN - オキッドについて定義されているとおりである。 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 m および n の好ましい定義は、式 (I) の化合物について定義されているとおりである。

50

【 0 0 8 3 】

本発明に係る化合物の他の好ましい群は式 (I - 5) のものであり、

【 化 9 】



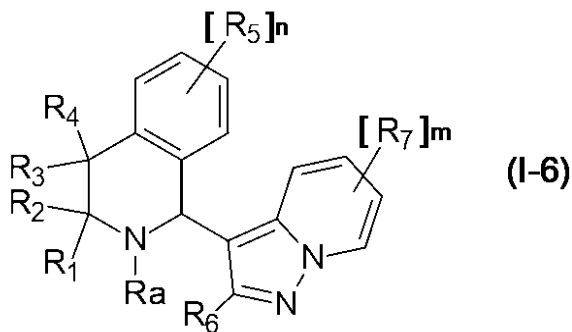
10

式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 m および n は、式 (I) の化合物、または、その塩もしくはN - オキッドについて定義されているとおりである。 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 m および n の好ましい定義は、式 (I) の化合物について定義されているとおりである。

【 0 0 8 4 】

本発明に係る化合物の他の好ましい群は式 (I - 6) のものであり、

【 化 1 0 】



20

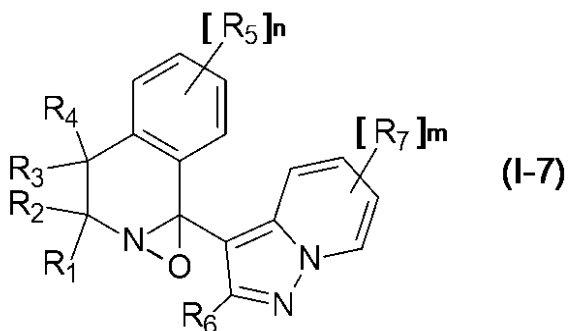
式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R_a 、 m および n は、式 (I) の化合物、または、その塩もしくはN - オキッドについて定義されているとおりである。 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R_a 、 m および n の好ましい定義は、式 (I) の化合物について定義されているとおりである。

30

【 0 0 8 5 】

本発明に係る化合物の他の好ましい群は式 (I - 7) のものであり、

【 化 1 1 】



40

式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 m および n は、式 (I) の化合物、または、その塩もしくはN - オキッドについて定義されているとおりである。 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 m および n の好ましい定義は、式 (I) の化合物について定義され

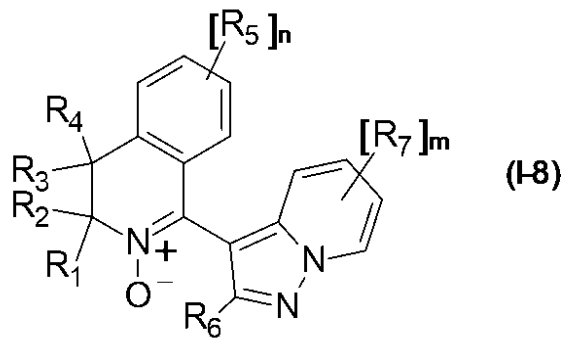
50

ているとおりである。

【0086】

本発明に係る化合物の他の好ましい群は式(I-8)のものであり、

【化12】



10

式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 m および n は、式(I)の化合物、または、その塩もしくはN-オキッドについて定義されているとおりである。 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 m および n の好ましい定義は、式(I)の化合物について定義されているとおりである。

【0087】

本発明に係る化合物のさらに好ましい群は、Y-Xが式(I)の化合物について定義されているとおりであり； R_1 および R_2 が各々、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1~3個の置換基で置換され得；または、 R_1 および R_2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルおよび $C_1 \sim C_6$ アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換され得る）を表し； R_3 および R_4 が各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキル、アルコキシおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1~3個の置換基で置換され得；または、 R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ 、 $C=NOR_d$ 、 $C=C(R_b)(R_c)$ または $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換され得る）を表し、式中、 R_b および R_c は各々、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択され、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1~3個の置換基で置換され得、および、式中、 R_d は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルおよび $C_3 \sim C_6$ アルキニルから選択され、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1~3個の置換基で置換され得；または、 R_2 および R_3 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換され得、かつ、さらに、環炭素単位は、酸素または硫黄原子により置き換えられ得る）を表し；各 R_5 が独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $-C(=NOR_a)C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、ヘテロアリール（式中

20

30

40

50

、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである)、フェノキシまたはヘテロアリーロキシ(式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである)を表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、フェニルおよびヘテロアリール基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、シアノおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1~5個の置換基で置換され得; nが、0、1、2、3または4であり; R_6 が、水素、ハロゲン、または $C_1 \sim C_2$ アルキルであり; 各 R_7 が独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシまたは $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシを表し; mが、0、1、2、3または4であり; および、 R_a が水素または $C_1 \sim C_2$ アルキルである式(I)の化合物、または、その塩もしくはN-オキシドである、式(I-9)のものである。

10

【0088】

この実施形態に係る化合物の一群は、 Q_1 が窒素原子であり、および、 Q_2 が炭素原子である式(I-9)の化合物である、式(I-9a)の化合物である。

【0089】

この実施形態に係る化合物の好ましい群は、 Q_1 が炭素原子であり、および、 Q_2 が窒素原子である式(I-9)の化合物である、式(I-9b)の化合物である。

20

【0090】

本発明に係る化合物のさらに好ましい群は、Y-XがラジカルG1を表し; R_1 および R_2 が各々、独立して、水素または $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり、ここで、アルキル基は、任意選択により、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択される1~3個の置換基で置換され得; または、 R^1 および R^2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル基を表し; R_3 および R_4 が各々、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルおよび $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオから独立して選択される1~3個の置換基で置換され得; または、 R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ 、 $C=NOR_d$ または $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル(これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換され得る)を表し、式中、 R_d は、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキルおよび $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルから選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ(好ましくは、 R_d は水素および $C_1 \sim C_3$ アルキルから選択され、ここで、アルキル基は、任意選択により、1~3個のハロゲン原子(好ましくはフッ素原子)で置換され得る)から独立して選択される1~3個の置換基で置換され得; 各 R_5 が独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、フェニル、ヘテロアリール(式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チアゾリルまたはオキサゾリルである)を表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、フェニルおよびヘテロアリール基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキルおよび $C_1 \sim C_3$ アルコキシから独立して選択される1~3個の置換基で置換され得; nが、0、1または2であり; R_6 が、水素、フルオロ、クロロまたはメチルであり; 各 R_7 が独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオまたは $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し; および、mが、0、1または2である式(I)の化合物、または、その塩もしくはN-オキシドである、式(I-10)のものである。

30

40

【0091】

50

この実施形態に係る化合物の一群は、 Q_1 が窒素原子であり、および、 Q_2 が炭素原子である式(I-10)の化合物である、式(I-10a)の化合物である。

【0092】

この実施形態に係る化合物の好ましい群は、 Q_1 が炭素原子であり、および、 Q_2 が窒素原子である式(I-10)の化合物である、式(I-10b)の化合物である。

【0093】

本発明に係る化合物のさらに好ましい群は、式中、 $Y-X$ がラジカルG1を表し； R_1 および R_2 が各々、独立して、 $C_1 \sim C_3$ アルキルであり；または、 R_1 および R_2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル基を表し； R_3 および R_4 が各々、水素、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_4$ アルキルから独立して選択され；または、 R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ または $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し；各 R_5 が独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し； n が、0、1または2であり； R_6 が、水素、ハロゲン、または $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；各 R_7 が独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し；および m が、0、1または2である式(I)の化合物、または、その塩もしくはN-オキシドである、式(I-11)のものである。

10

【0094】

この実施形態に係る化合物の一群は、 Q_1 が窒素原子であり、および、式中、 Q_2 が炭素原子である式(I-11)の化合物である、式(I-11a)の化合物である。

20

【0095】

この実施形態に係る化合物の好ましい群は、 Q_1 が炭素原子であり、および、 Q_2 が窒素原子である式(I-11)の化合物である、式(I-11b)の化合物である。

【0096】

本発明に係る化合物のさらに好ましい群は、 $Y-X$ がラジカルG1を表し； R_1 および R_2 が各々、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキル基（好ましくは、共にメチル）であり； R_3 および R_4 が各々、水素、フルオロおよび $C_1 \sim C_2$ アルキル（好ましくは、共にメチルであるか、または、共にフルオロである）から独立して選択され；または、 R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し；各 R_5 が独立して、フルオロ、クロロ、プロモ、シアノまたは $C_1 \sim C_2$ アルキル（好ましくはフルオロ）を表し； n が、0、1または2（好ましくは0または1）であり； R_6 が水素であり；各 R_7 が独立して、フルオロ、クロロまたは $C_1 \sim C_3$ アルキル（好ましくはフルオロまたはメチル）を表し；および、 m が1または2である式(I)の化合物、または、その塩もしくはN-オキシドである、式(I-12)のものである。

30

【0097】

この実施形態に係る化合物の一群は、 Q_1 が窒素原子であり、および、 Q_2 が炭素原子である式(I-12)の化合物である、式(I-12a)の化合物である。

【0098】

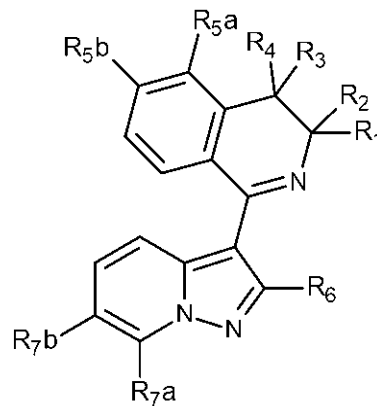
この実施形態に係る化合物の好ましい群は、 Q_1 が炭素原子であり、および、 Q_2 が窒素原子である式(I-12)の化合物である、式(I-12b)の化合物である。

40

【0099】

化合物の特に好ましい群は、式(IK)の化合物

【化 1 3】



(IK)

(式中、 R_1 はメチルであり； R_2 はメチルであり； R_3 はメチルまたはフルオロであり； R_4 はメチルまたはフルオロであり； R_{5a} はフルオロまたは水素であり； R_{5b} はフルオロまたは水素であり； R_6 は水素であり； R_{7a} はメチルまたは水素であり；および、 R_7b はメチル、フルオロまたは水素である)、または、その塩もしくはN - オキシドである。

【0100】

式(IK)の化合物においては、 R_1 がメチルであり、 R_2 がメチルであり、 R_6 が水素であり、および、 R_3 、 R_4 、 R_{5a} 、 R_{5b} 、 R_{7a} および R_{7b} が以下に定義されているとおりである化合物が特に好ましい。

【0101】

【表1】

化合物	R_3	R_4	R_{5a}	R_{5b}	R_{7a}	R_{7b}
IK-1	メチル	メチル	フルオロ	水素	メチル	メチル
IK-2	フルオロ	フルオロ	フルオロ	水素	メチル	メチル
IK-3	フルオロ	フルオロ	水素	フルオロ	メチル	メチル
IK-4	フルオロ	フルオロ	水素	水素	メチル	メチル
IK-5	フルオロ	フルオロ	水素	水素	メチル	フルオロ
IK-6	フルオロ	フルオロ	水素	水素	メチル	水素
IK-7	フルオロ	フルオロ	水素	水素	水素	メチル
IK-8	メチル	メチル	フルオロ	水素	メチル	水素
IK-9	フルオロ	フルオロ	水素	フルオロ	メチル	水素
IK-10	フルオロ	フルオロ	水素	フルオロ	水素	メチル

【0102】

本発明に係る化合物は、とりわけ、真菌によって引き起こされる病害に対する植物の保護に係る有利なレベルの生物学的活性、または、農芸化学活性成分としての使用に係る優れた特性(例えば、高い生物学的活性、有利な活性スペクトル、高い安全プロファイル、向上した物理化学的特性または高い生分解性)を含む、多数の有益性を有し得る。

【0103】

式(I)の化合物の特定の例が、以下の表A1~A17およびB1~B17に例示されている：

表A1は195種の式Iaの化合物を提供しており、

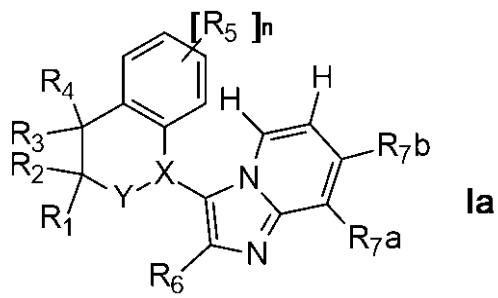
10

20

30

40

【化 1 4】



10

式中、 R_6 、 R_{7a} および R_{7b} は全てHであり、ならびに、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびラジカルY - X（および、Y - XがG2である場合、対応するRa）の値は、以下の表Zにおいて定義されているとおりである。

【0104】

【表 2 - 1】

表 Z

項目	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	Y-X*	Ra
1	CH ₃	CH ₃	H	H	H [n=0]	G1	-
2	CH ₃	CH ₃	H	H	5-F	G1	-
3	CH ₃	CH ₃	H	H	6-F	G1	-
4	CH ₃	CH ₃	H	H	7-F	G1	-
5	CH ₃	CH ₃	H	H	8-F	G1	-
6	CH ₃	CH ₃	H	H	5-Cl	G1	-
7	CH ₃	CH ₃	H	H	6-Cl	G1	-
8	CH ₃	CH ₃	H	H	7-Cl	G1	-
9	CH ₃	CH ₃	H	H	8-Cl	G1	-
10	CH ₃	CH ₃	H	H	5-Br	G1	-
11	CH ₃	CH ₃	H	H	6-Br	G1	-
12	CH ₃	CH ₃	H	H	5-I	G1	-
13	CH ₃	CH ₃	H	H	5,6-F ₂	G1	-
14	CH ₃	CH ₃	H	H	5,6-Cl ₂	G1	-
15	CH ₃	CH ₃	H	H	5-F-6-Cl	G1	-
16	CH ₃	CH ₃	H	H	5-CH ₃	G1	-
17	CH ₃	CH ₃	H	H	6-CH ₃	G1	-
18	CH ₃	CH ₃	H	H	7-CH ₃	G1	-
19	CH ₃	CH ₃	H	H	5-CH ₂ CH ₃	G1	-
20	CH ₃	CH ₃	H	H	5-シクロプロピル	G1	-
21	CH ₃	CH ₃	H	H	5-CN	G1	-
22	CH ₃	CH ₃	H	H	5-OCH ₃	G1	-
23	CH ₃	CH ₃	H	H	5-OC ₆ H ₅	G1	-
24	CH ₃	CH ₃	H	H	5-O-(ピリド-2-イル)	G1	-
25	CH ₃	CH ₃	H	H	5-CF ₃	G1	-
26	CH ₃	CH ₃	H	H	5-C ₆ H ₆	G1	-
27	CH ₃	CH ₃	H	H	5-(2-F-C ₆ H ₅)	G1	-
28	CH ₃	CH ₃	H	H	5-(チアゾール-2-イル)	G1	-
29	CH ₃	CH ₃	H	H	H [n=0]	G2	H
30	CH ₃	CH ₃	H	H	5-F	G2	H
31	CH ₃	CH ₃	H	H	H [n=0]	G2	CH ₃
32	CH ₃	CH ₃	H	H	5-F	G2	CH ₃
33	CH ₃	CH ₃	H	H	H [n=0]	G3	-
34	CH ₃	CH ₃	H	H	5-F	G3	-
35	CH ₃	CH ₃	H	H	H [n=0]	G4	-

10

20

30

40

【表 2 - 2】

項目	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	Y-X*	Ra
36	CH ₃	CH ₃	H	H	5-F	G4	-
37	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H [n=0]	G1	-
38	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	5-F	G1	-
39	CH ₃	CH ₃	H	OH	H [n=0]	G1	-
40	CH ₃	CH ₃	H	OH	5-F	G1	-
41	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	H [n=0]	G1	-
42	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	5-F	G1	-
43	CH ₃	CH ₃	H	F	H [n=0]	G1	-
44	CH ₃	CH ₃	H	F	5-F	G1	-
45	CH ₃	CH ₃	H	F	6-F	G1	-
46	CH ₃	CH ₃	H	F	5-Cl	G1	-
47	CH ₃	CH ₃	H	F	6-Cl	G1	-
48	CH ₃	CH ₃	H	F	5-CH ₃	G1	-
49	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G1	-
50	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F	G1	-
51	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	6-F	G1	-
52	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	7-F	G1	-
53	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	8-F	G1	-
54	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-Cl	G1	-
55	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	6-Cl	G1	-
56	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-Br	G1	-
57	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5,6-F ₂	G1	-
58	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5,6-Cl ₂	G1	-
59	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F-6-Cl	G1	-
60	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-CH ₃	G1	-
61	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-CH ₂ CH ₃	G1	-
62	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-シクロプロピル	G1	-
63	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-CN	G1	-
64	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-OC ₆ H ₅	G1	-
65	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-O-(ピリド-2-イル)	G1	-
66	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-C ₆ H ₆	G1	-
67	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-(2-F-C ₆ H ₅)	G1	-
68	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-(チアゾール-2-イル)	G1	-
69	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G2	H
70	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F	G2	H
71	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G2	CH ₃
72	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F	G2	CH ₃

10

20

30

40

【表 2 - 3】

項目	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	Y-X*	Ra
73	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G3	-
74	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F	G3	-
75	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G4	-
76	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F	G4	-
77	CH ₃	CH ₃	=O		H [n=0]	G1	-
78	CH ₃	CH ₃	=O		5-F	G1	-
79	CH ₃	CH ₃	=O		6-F	G1	-
80	CH ₃	CH ₃	=O		5-Cl	G1	-
81	CH ₃	CH ₃	=O		6-Cl	G1	-
82	CH ₃	CH ₃	=O		5-Br	G1	-
83	CH ₃	CH ₃	=O		5-CN	G1	-
84	CH ₃	CH ₃	=O		5-CH ₃	G1	-
85	CH ₃	CH ₃	=O		5-CH ₂ CH ₃	G1	-
86	CH ₃	CH ₃	=NOH		H [n=0]	G1	-
87	CH ₃	CH ₃	=NOH		5-F	G1	-
88	CH ₃	CH ₃	=NOH		5-CH ₃	G1	-
89	CH ₃	CH ₃	=NOCH ₃		H [n=0]	G1	-
90	CH ₃	CH ₃	=NOCH ₃		5-F	G1	-
91	CH ₃	CH ₃	=NOCH ₃		5-CH ₃	G1	-
92	CH ₃	CH ₃	=NOCH ₃		5-Cl	G1	-
93	CH ₃	CH ₃	F	F	H [n=0]	G1	-
94	CH ₃	CH ₃	F	F	5-F	G1	-
95	CH ₃	CH ₃	F	F	6-F	G1	-
96	CH ₃	CH ₃	F	F	5-Cl	G1	-
97	CH ₃	CH ₃	F	F	6-Cl	G1	-
98	CH ₃	CH ₃	F	F	5-Br	G1	-
99	CH ₃	CH ₃	F	F	5,6-F ₂	G1	-
100	CH ₃	CH ₃	F	F	5-F-6-Cl	G1	-
101	CH ₃	CH ₃	F	F	5-CN	G1	-
102	CH ₃	CH ₃	F	F	5-CH ₃	G1	-
103	CH ₃	CH ₃	シクロプロピル		H [n=0]	G1	-
104	CH ₃	CH ₃	シクロプロピル		5-F	G1	-
105	CH ₃	CH ₃	シクロプロピル		5-Cl	G1	-
106	CH ₃	CH ₃	シクロプロピル		5-CN	G1	-
107	CH ₃	CH ₃	シクロプロピル		5-CH ₃	G1	-
108	CH ₃	CH ₃	シクロブチル		H [n=0]	G1	-
109	CH ₃	CH ₃	シクロブチル		5-F	G1	-
110	CH ₃	CH ₃	シクロペンチル		H [n=0]	G1	-

10

20

30

40

【表 2 - 4】

項目	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	Y-X*	Ra
111	CH ₃	CH ₃	シクロペンチル		5-F	G1	-
112	H	H	CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G1	-
113	H	H	シクロプロピル		H [n=0]	G1	-
114	H	H	シクロプロピル		5-F	G1	-
115	H	H	シクロブチル		H [n=0]	G1	-
116	H	H	シクロブチル		5-F	G1	-
117	H	H	シクロペンチル		H [n=0]	G1	-
118	H	H	シクロペンチル		5-F	G1	-
119	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	H [n=0]	G1	-
120	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	5-F	G1	-
121	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	5-Cl	G1	-
122	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	5-Br	G1	-
123	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	5-CH ₃	G1	-
124	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	H [n=0]	G1	-
125	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	5-F	G1	-
126	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	5-Cl	G1	-
127	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	5-Br	G1	-
128	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	5-CH ₃	G1	-
129	CH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H [n=0]	G1	-
130	CH ₃	CH ₂ Cl	H	H	5-F	G1	-
131	CH ₃	CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G1	-
132	CH ₃	CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	5-F	G1	-
133	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	H	H	H [n=0]	G1	-
134	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	H	H	5-F	G1	-
135	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G1	-
136	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F	G1	-
137	CH ₃	H	H	H	H [n=0]	G1	-
138	CH ₃	H	H	H	5-F	G1	-
139	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	H	H [n=0]	G1	-
140	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	H	5-F	G1	-
141	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H [n=0]	G1	-
142	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	5-F	G1	-
143	シクロプロピル		H	H	H [n=0]	G1	-
144	シクロプロピル		CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G1	-
145	シクロプロピル		=O		H [n=0]	G1	-
146	シクロプロピル		F	F	H [n=0]	G1	-
147	シクロプロピル		シクロプロピル		H [n=0]	G1	-
148	シクロプロピル		H	H	5-F	G1	-

10

20

30

40

【表 2 - 5】

項目	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	Y-X*	Ra
149		シクロプロピル	CH ₃	CH ₃	5-F	G1	-
150		シクロプロピル	= O		5-F	G1	-
151		シクロプロピル	F	F	5-F	G1	-
152		シクロプロピル	シクロプロピル		5-F	G1	-
153		シクロプロピル	H	H	5-Cl	G1	-
154		シクロプロピル	H	H	5-Br	G1	-
155		シクロブチル	H	H	H [n=0]	G1	-
156		シクロブチル	= O		H [n=0]	G1	-
157		シクロブチル	F	F	H [n=0]	G1	-
158		シクロブチル	H	H	5-F	G1	-
159		シクロブチル	= O		5-F	G1	-
160		シクロブチル	F	F	5-F	G1	-
161		シクロブチル	H	H	5-Br	G1	-
162		シクロペンチル	H	H	H [n=0]	G1	-
163		シクロペンチル	= O		H [n=0]	G1	-
164		シクロペンチル	F	F	H [n=0]	G1	-
165		シクロペンチル	H	H	5-F	G1	-
166		シクロペンチル	= O		5-F	G1	-
167		シクロペンチル	F	F	5-F	G1	-
168		シクロペンチル	H	H	5-Br	G1	-
169		シクロヘキシル	H	H	H [n=0]	G1	-
170		シクロヘキシル	= O		H [n=0]	G1	-
171		シクロヘキシル	F	F	H [n=0]	G1	-
172		シクロヘキシル	H	H	5-F	G1	-
173		シクロヘキシル	= O		5-F	G1	-
174		シクロヘキシル	F	F	5-F	G1	-
175		シクロヘキシル	H	H	5-Br	G1	-
176	H	シクロプロピル		H	H [n=0]	G1	-
177	CH ₃	シクロプロピル		H	H [n=0]	G1	-
178	CH ₃	シクロプロピル		CH ₃	H [n=0]	G1	-
179	CH ₃	シクロプロピル		F	H [n=0]	G1	-
180	H	シクロプロピル		H	5-F	G1	-
181	CH ₃	シクロプロピル		H	5-F	G1	-
182	CH ₃	シクロプロピル		CH ₃	5-F	G1	-
183	H	シクロブチル		H	H [n=0]	G1	-
184	CH ₃	シクロブチル		H	H [n=0]	G1	-
185	CH ₃	シクロブチル		CH ₃	H [n=0]	G1	-
186	CH ₃	シクロブチル		F	H [n=0]	G1	-

10

20

30

40

【表 2 - 6】

項目	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	Y-X*	Ra
187	H	シクロブチル		H	5-F	G1	-
188	CH ₃	シクロブチル		H	5-F	G1	-
189	CH ₃	シクロブチル		CH ₃	5-F	G1	-
190	H	シクロペンチル		H	H [n=0]	G1	-
191	CH ₃	シクロペンチル		H	H [n=0]	G1	-
192	CH ₃	シクロペンチル		CH ₃	H [n=0]	G1	-
193	H	シクロヘキシル		H	H [n=0]	G1	-
194	CH ₃	シクロヘキシル		H	H [n=0]	G1	-
195	CH ₃	シクロヘキシル		CH ₃	H [n=0]	G1	-

*ラジカル G1、G2、G3 および G4 は式(I)の化合物について定義されているとおりである。

【 0 1 0 5 】

表 A 2 は 1 9 5 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R₇a および R₇b は H であり、R₆ はメチルであり、ならびに、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅ およびラジカル Y - X (および、Y - X が G 2 である場合、対応する R a) の値は、上記の表 Z に定義されているとおりである。

【 0 1 0 6 】

表 A 3 は 1 9 5 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R₇a および R₇b は H であり、R₆ はクロロであり、ならびに、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅ およびラジカル Y - X (および、Y - X が G 2 である場合、対応する R a) の値は、上記の表 Z に定義されているとおりである。

【 0 1 0 7 】

表 A 4 は 1 9 5 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R₆ および R₇a は H であり、R₇b はメチルであり、ならびに、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅ およびラジカル Y - X (および、Y - X が G 2 である場合、対応する R a) の値は、上記の表 Z に定義されているとおりである。

【 0 1 0 8 】

表 A 5 は 1 9 5 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R₆ および R₇b は H であり、R₇a はフルオロであり、ならびに、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅ およびラジカル Y - X (および、Y - X が G 2 である場合、対応する R a) の値は、上記の表 Z に定義されているとおりである。

【 0 1 0 9 】

表 A 6 は 1 9 5 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R₆ および R₇b は H であり、R₇a はメチルであり、ならびに、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅ およびラジカル Y - X (および、Y - X が G 2 である場合、対応する R a) の値は、上記の表 Z に定義されているとおりである。

【 0 1 1 0 】

表 A 7 は 1 9 5 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R₆ および R₇b は H であり、R₇a はクロロであり、ならびに、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅ およびラジカル Y - X (および、Y - X が G 2 である場合、対応する R a) の値は、上記の表 Z に定義されているとおりである。

【 0 1 1 1 】

表 A 8 は 1 9 5 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R₆ および R₇b は H であり、R₇a はプロモであり、ならびに、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅ およびラジカル Y - X (および、Y - X が G 2 である場合、対応する R a) の値は、上記の表 Z に定義

10

20

30

40

50

されているとおりである。

【0112】

表A9は195種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、R₆およびR_{7b}はHであり、R_{7a}はエチルであり、ならびに、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅およびラジカルY-X（および、Y-XがG2である場合、対応するRa）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0113】

表A10は195種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、R₆およびR_{7b}はHであり、R_{7a}はシクロプロピルであり、ならびに、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅およびラジカルY-X（および、Y-XがG2である場合、対応するRa）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

10

【0114】

表A11は195種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、R₆はHであり、R_{7b}はメチルであり、R_{7a}はフルオロであり、ならびに、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅およびラジカルY-X（および、Y-XがG2である場合、対応するRa）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0115】

表A12は195種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、R₆はHであり、R_{7b}はクロロであり、R_{7a}はクロロであり、ならびに、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅およびラジカルY-X（および、Y-XがG2である場合、対応するRa）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

20

【0116】

表A13は195種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、R₆はHであり、R_{7b}はフルオロであり、R_{7a}はメチルであり、ならびに、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅およびラジカルY-X（および、Y-XがG2である場合、対応するRa）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0117】

表A14は195種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、R₆はHであり、R_{7b}はメチルであり、R_{7a}はメチルであり、ならびに、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅およびラジカルY-X（および、Y-XがG2である場合、対応するRa）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

30

【0118】

表A15は195種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、R₆はHであり、R_{7b}はクロロであり、R_{7a}はメチルであり、ならびに、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅およびラジカルY-X（および、Y-XがG2である場合、対応するRa）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0119】

表A16は195種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、R₆はHであり、R_{7b}はメチルであり、R_{7a}はクロロであり、ならびに、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅およびラジカルY-X（および、Y-XがG2である場合、対応するRa）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

40

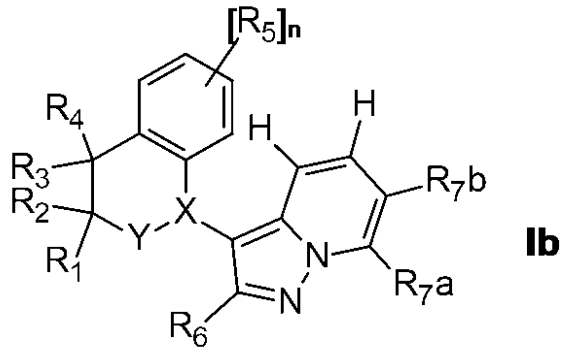
【0120】

表A17は195種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、R₆はHであり、R_{7b}はフルオロであり、R_{7a}はシクロプロピルであり、ならびに、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅およびラジカルY-X（および、Y-XがG2である場合、対応するRa）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0121】

表B1は、195種の式Ibの化合物を開示しており

【化15】



10

式中、 R_6 、 R_7a および R_7b はHであり、ならびに、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびラジカル $Y-X$ （および、 $Y-X$ がG2である場合、対応する Ra ）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0122】

表B2は195種の式Ibの化合物を提供するものであり、式中、 R_7a および R_7b はHであり、 R_6 はメチルであり、ならびに、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびラジカル $Y-X$ （および、 $Y-X$ がG2である場合、対応する Ra ）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0123】

20

表B3は195種の式Ibの化合物を提供するものであり、式中、 R_7a および R_7b はHであり、 R_6 はクロロであり、ならびに、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびラジカル $Y-X$ （および、 $Y-X$ がG2である場合、対応する Ra ）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0124】

表B4は195種の式Ibの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 および R_7a はHであり、 R_7b はメチルであり、ならびに、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびラジカル $Y-X$ （および、 $Y-X$ がG2である場合、対応する Ra ）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0125】

30

表B5は195種の式Ibの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 および R_7b はHであり、 R_7a はフルオロであり、ならびに、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびラジカル $Y-X$ （および、 $Y-X$ がG2である場合、対応する Ra ）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0126】

表B6は195種の式Ibの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 および R_7b はHであり、 R_7a はメチルであり、ならびに、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびラジカル $Y-X$ （および、 $Y-X$ がG2である場合、対応する Ra ）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0127】

40

表B7は195種の式Ibの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 および R_7b はHであり、 R_7a はクロロであり、ならびに、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびラジカル $Y-X$ （および、 $Y-X$ がG2である場合、対応する Ra ）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0128】

表B8は195種の式Ibの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 および R_7b はHであり、 R_7a はプロモであり、ならびに、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびラジカル $Y-X$ （および、 $Y-X$ がG2である場合、対応する Ra ）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0129】

50

表B 9は195種の式I bの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 および R_7b はHであり、 R_7a はエチルであり、ならびに、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびラジカル $Y-X$ （および、 $Y-X$ がG 2である場合、対応する R_a ）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0130】

表B 10は195種の式I bの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 および R_7b はHであり、 R_7a はシクロプロピルであり、ならびに、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびラジカル $Y-X$ （および、 $Y-X$ がG 2である場合、対応する R_a ）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0131】

表B 11は195種の式I bの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 はHであり、 R_7b はメチルであり、 R_7a はフルオロであり、ならびに、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびラジカル $Y-X$ （および、 $Y-X$ がG 2である場合、対応する R_a ）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0132】

表B 12は195種の式I bの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 はHであり、 R_7b はクロロであり、 R_7a はクロロであり、ならびに、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびラジカル $Y-X$ （および、 $Y-X$ がG 2である場合、対応する R_a ）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0133】

表B 13は195種の式I bの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 はHであり、 R_7b はフルオロであり、 R_7a はメチルであり、ならびに、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびラジカル $Y-X$ （および、 $Y-X$ がG 2である場合、対応する R_a ）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0134】

表B 14は195種の式I bの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 はHであり、 R_7b はメチルであり、 R_7a はメチルであり、ならびに、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびラジカル $Y-X$ （および、 $Y-X$ がG 2である場合、対応する R_a ）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0135】

表B 15は195種の式I bの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 はHであり、 R_7b はクロロであり、 R_7a はメチルであり、ならびに、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびラジカル $Y-X$ （および、 $Y-X$ がG 2である場合、対応する R_a ）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0136】

表B 16は195種の式I cの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 はHであり、 R_7b はメチルであり、 R_7a はクロロであり、ならびに、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびラジカル $Y-X$ （および、 $Y-X$ がG 2である場合、対応する R_a ）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0137】

表B 17は195種の式I bの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 はHであり、 R_7b はフルオロであり、 R_7a はシクロプロピルであり、ならびに、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびラジカル $Y-X$ （および、 $Y-X$ がG 2である場合、対応する R_a ）の値は、上記の表Zに定義されているとおりである。

【0138】

本発明の化合物は以下のスキームにおいて示されているとおり生成することが可能であり、ここで、別段の定めがある場合を除き、各可変要素の定義は、式(I)の化合物について上記に定義されているとおりである。

【0139】

式I - 1の化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は、式（

10

20

30

40

50

I) の化合物について定義されているとおりである) は、式 I I I の化合物 (式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式 I の化合物について定義されているとおりである) を伴う、例えば硫酸、トリフルオロ酢酸またはトリフルオロメタンスルホン酸による酸性条件下における、式 I I の化合物 (式中、 R^6 、 R^7 および m は式 (I) の化合物について定義されているとおりである) の変換により得ることが可能である。これはスキーム 1 に示されている。

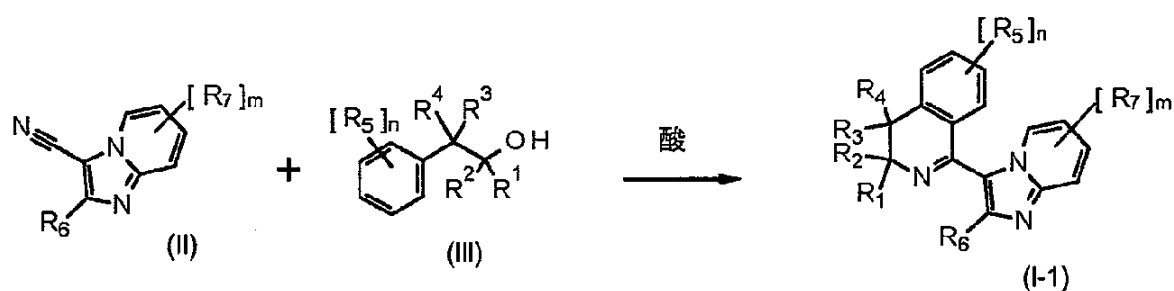
【 0 1 4 0 】

式 I I I の化合物は、例えば対応する酢酸フェニルエステルへのグリニャール試薬の添加 (例えば: *Journal of the American Chemical Society*, 1989, 111 (12), 4392 - 8 を参照のこと) といった、多様な公知の方法によって得ることが可能である。

10

【 化 1 6 】

スキーム 1



20

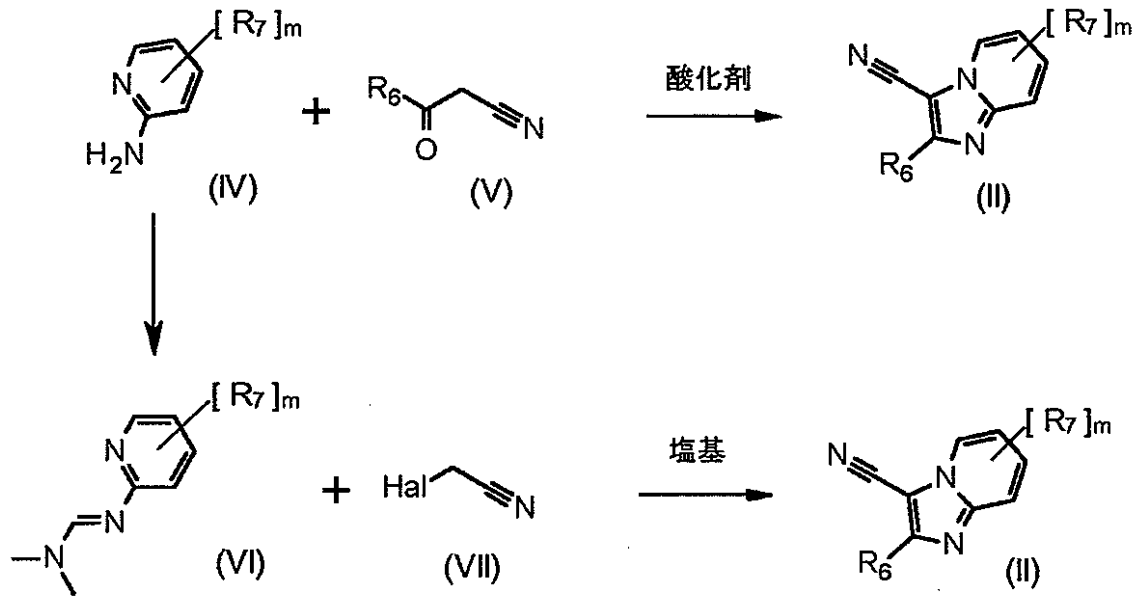
【 0 1 4 1 】

式 I I の化合物 (式中、 R_6 、 R_7 および m は、式 I の化合物について定義されているとおりである) は、式 V の化合物 (これは市販されているか、または、多様な公知の方法により入手可能である) (式中、 R_6 は、式 I の化合物について定義されているとおりである) を伴う、例えばヨードベンゼン I, I - 二酢酸による酸化性条件下における、式 I V のアミノピリジン (これは市販されているか、または、多様な公知の方法により入手可能である) (式中、 R_7 および m は、式 I の化合物について定義されているとおりである) の変換により得ることが可能である。あるいは、式 I I の化合物 (式中、 R_6 は H であり、ならびに、 R_7 および m は、式 I の化合物について定義されているとおりである) は、式 V I I の化合物 (これは市販されているか、または、多様な公知の方法により入手可能である) (式中、 $H a l$ は好ましくはクロロまたはブromoといったハロゲンである) を伴う、例えば炭酸ナトリウムによる塩基性条件下における、式 V I のアミジン (これは市販されているか、または、多様な公知の方法により入手可能である) (式中、 R^7 および m は、式 I の化合物について定義されているとおりである) の変換により得ることが可能である。これはスキーム 2 に示されている。

30

【化17】

スキーム2



10

【0142】

式 I - 1 の化合物 (式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は、式 I の化合物について定義されているとおりである) は、式 IX の化合物 (式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は、式 (I) の化合物について定義されているとおりであり、ならびに、 Hal は、好ましくはクロロまたはプロモといったハロゲンである) を伴う、鈴木 - 宮浦反応の条件下における式 VII I の化合物 (式中、 R_6 、 R_7 および m は、式 (I) の化合物について定義されているとおりであり、ならびに、 R_8 はヒドロキシルであるか、または、2 個の R^8 が介在するホウ素原子と一緒になって 5 員もしくは 6 員飽和複素環を形成している) の変換により得ることも可能である。これはスキーム 3 に示されている。

20

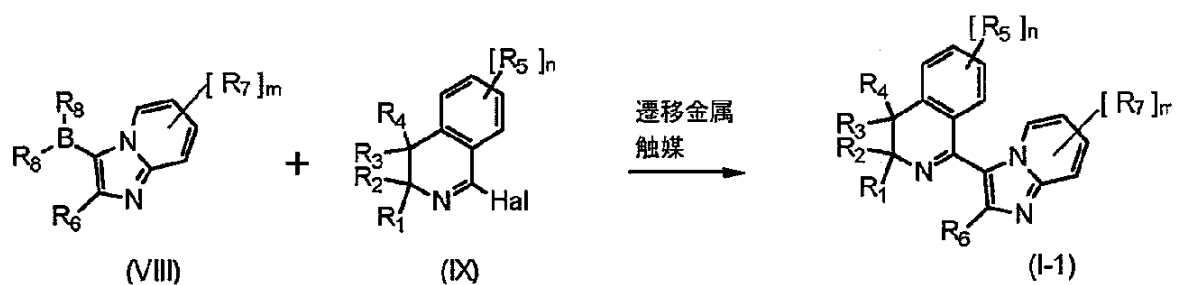
【0143】

式 VII I の化合物は、公知の方法 (例えば: *Eur. J. Org. Chem.* 2011, 24, 4654 または *Tetrahedron* 2008, 64, 4596 を参照のこと) により調製可能である。

30

【化18】

スキーム3



40

【0144】

式 IX の化合物 (式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式 (I) の化合物に定義されているとおりであり、ならびに、 Hal はハロゲン、好ましくはクロロまたはプロモである) は、オキシ塩化リン、オキシ臭化リン、塩化チオニル、臭化チオニルもしくはヴィルスマイヤー試薬などのハロゲン化試薬を伴う、式 X の化合物 (式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式 I の化合物に定義されているとおりである) の変換により得るこ

50

とが可能である。これをスキーム 4 に示す。

【化 19】

スキーム 4



10

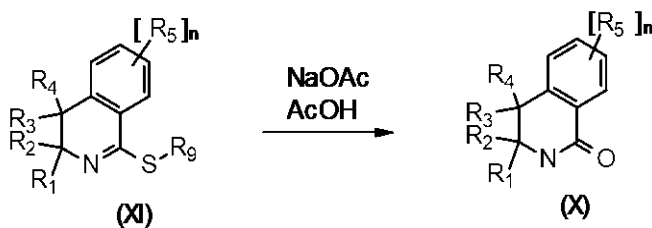
【0145】

式 X の化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は、式 I の化合物について定義されているとおりである）は、当業者に公知である数々の変換により得ることが可能であり、例えば、これらは、文献（Yu. B. Vikharev et al. *Pharmaceutical Chemistry Journal*, 2005, 39, 405 - 408）に記載されているとおり、酢酸中の酢酸ナトリウムを伴う式 XI の化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は、式（I）の化合物について定義されているとおりであり、ならびに、 R_9 は $C_1 \sim C_6$ アルキルである）の変換により調製可能である。これはスキーム 5 に示されている。

20

【化 20】

スキーム 5



30

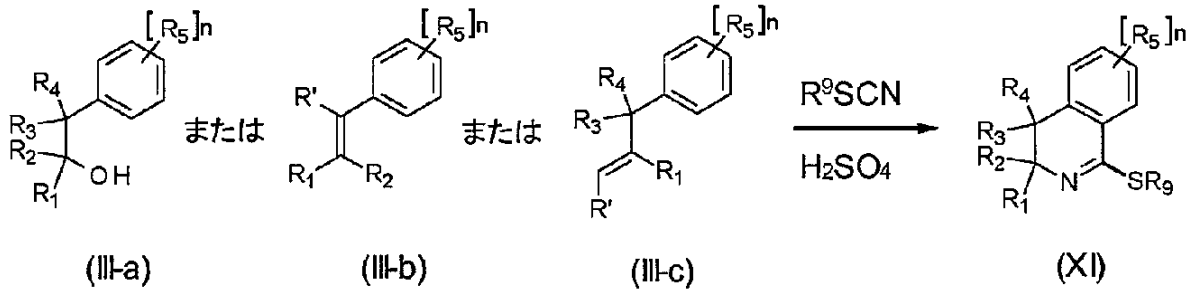
【0146】

式 XI の化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は、式（I）の化合物について定義されているとおりであり、ならびに、 R_9 は $C_1 \sim C_6$ アルキルである）は、文献（Yu. B. Vikharev et al. *Pharmaceutical Chemistry Journal*, 2005, 39, 405 - 408）に記載されているとおり、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオシアネートを伴う、例えば硫酸による酸性条件下における、式 III - a、III - b または III - c の化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は、式（I）の化合物について定義されているとおりであり、ならびに、 R' は、H または $C_1 \sim C_6$ アルキルである）の変換により得ることが可能である。これはスキーム 6 に示されている。

40

【化21】

スキーム6



10

【0147】

あるいは、式I-1の化合物（式中、 $R_1, R_2, R_3, R_4, R_5, R_6, R_7, m$ および n は、式Iの化合物について定義されているとおりである）は、式IXの化合物（式中、 R_1, R_2, R_3, R_4, R_5 および n は、式(I)の化合物について定義されているとおりであり、ならびに、 Hal は、好ましくはクロロまたはプロモといったハロゲンである）を伴う、スティール反応条件下における、式XIIの化合物（式中、 R_6, R_7 および m は、式(I)について定義されているとおりであり、ならびに、 R_{10} は $C_1 \sim C_6$ アルキルである）の変換により得ることが可能である。これはスキーム7に示されている。

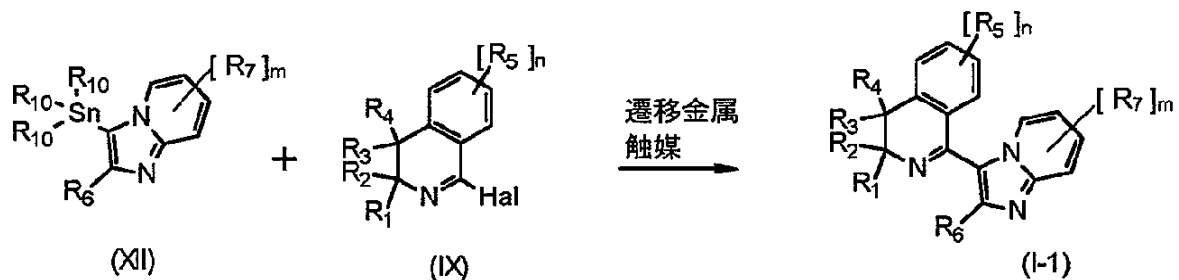
20

【0148】

式XIIの化合物は、公知の方法（例えば：*Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2013, 23, 2793を参照のこと）により調製可能である。

【化22】

スキーム7



30

【0149】

式III-a、III-bまたはIII-cの化合物（式中、 R_1, R_2, R_3, R_4, R_5 および n は式(I)の化合物に定義されているとおりであり、 R' は H または $C_1 \sim C_6$ アルキルである）は、市販されているか、または、当業者に公知である方法を用いて容易に調製される。

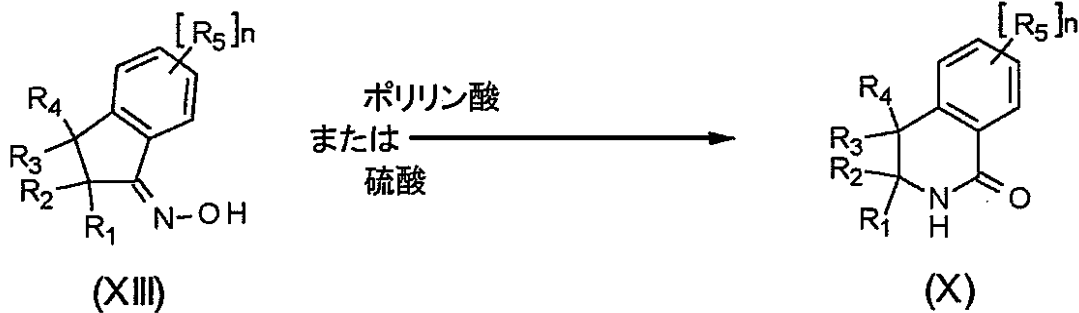
【0150】

あるいは、式Xの化合物（式中、 R_1, R_2, R_3, R_4, R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）は、文献（Jun-ichi Minamikawa, *Bioorganic & Medicinal Chemistry*, 2003, 11, 2205-2209）に記載されているとおり、例えば硫酸またはポリリン酸による酸性条件下における、式XIIIの化合物（式中、 R_1, R_2, R_3, R_4, R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）の変換により得ることが可能である。これをスキーム8に示す。

40

【化23】

スキーム8



10

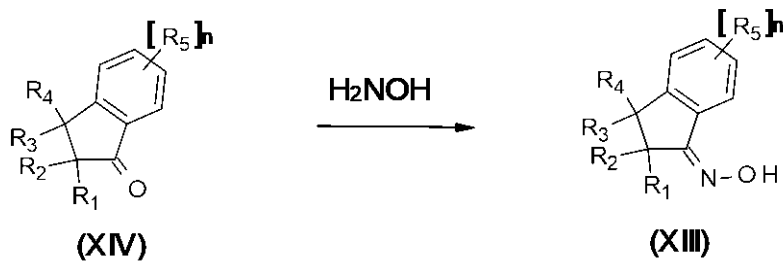
【0151】

式XIIIの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）は、エタノールまたはピリジンなどの溶剤中における、酢酸ナトリウムなどの塩基の存在下または不在下、周囲温度～加熱の範囲の温度でのヒドロキシルアミンまたは塩酸ヒドロキシルアミンを伴う処理による、式XIVの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）の変換により得ることが可能である。これをスキーム9に示す。

20

【化24】

スキーム9



30

【0152】

式XIVの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）は、市販されているか、または、当業者に公知である方法を用いて容易に調製される。

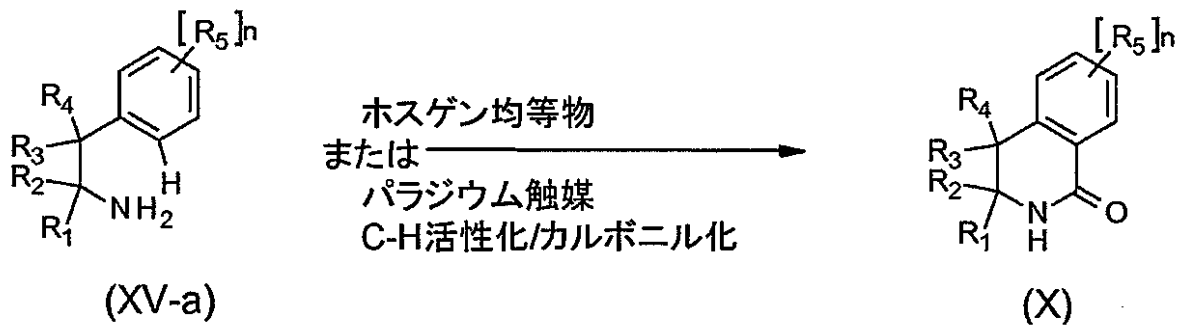
【0153】

あるいは、式Xの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）は、文献（Jaume Graneli et al. Chem. Commun., 2011, 47, 1054-1056）において報告されているとおり、ホスゲン、トリホスゲンもしくはカルボニルジイミダゾールなどのカルボニル化剤を伴う処理、および、その後の加熱、または、一酸化炭素ガス、酢酸パラジウムなどのパラジウム触媒およびベンゾキノンなどの酸化剤の存在下における直接触媒C-H活性化-カルボニル化の利用による、式XV-aの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）の変換により得ることが可能である。これをスキーム10に示す。

40

【化25】

スキーム10



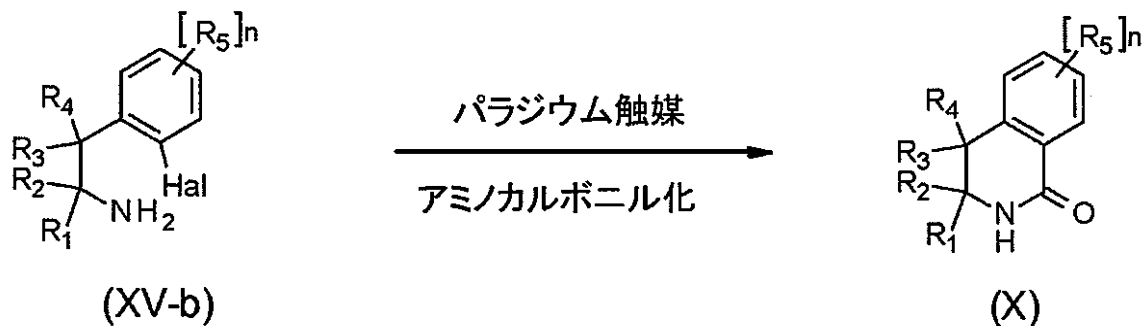
【0154】

あるいは、式Xの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）は、文献（Ruimao Hua et al. *Tetrahedron Letters*, 2013, 54, 5159-5161）に報告されているとおり、一酸化炭素ガス、ジクロロビス（トリシクロヘキシルホスフィン）パラジウム（II）もしくはジクロロビス（トリフェノールホスフィン）パラジウム（II）などのパラジウム触媒およびトリエチルアミン、ピロリジンなどの有機塩基または炭酸セシウムもしくは炭酸カリウムなどの無機塩基の存在下における分子内アミノカルボニル化の利用による、式XV-bの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式（I）の化合物に定義されているとおりであり、Halは、ハロゲン、好ましくはクロロ、プロモまたはヨードである）の変換により得ることが可能である。これをスキーム11に示す。

20

【化26】

スキーム11



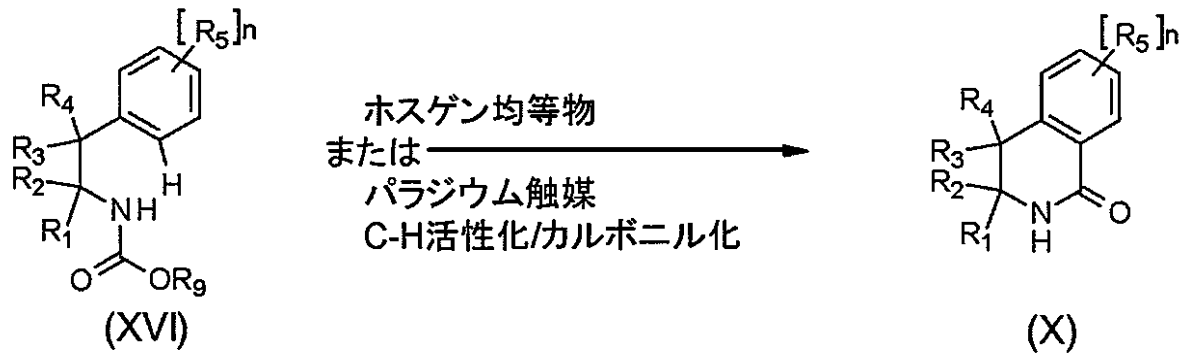
【0155】

あるいは、式Xの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）は、文献（Tomohiko Ohwada et al. *Journal of Organic Chemistry*, 2012, 77, 9313）に記載されているとおり、例えば硫酸またはトリフルイック酸による酸性条件下における、式XVIの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式（I）の化合物に定義されているとおりであり、 R_9 は $C_1 \sim C_6$ アルキルである）の変換により得ることが可能である。これをスキーム12に示す。

40

【化27】

スキーム12



10

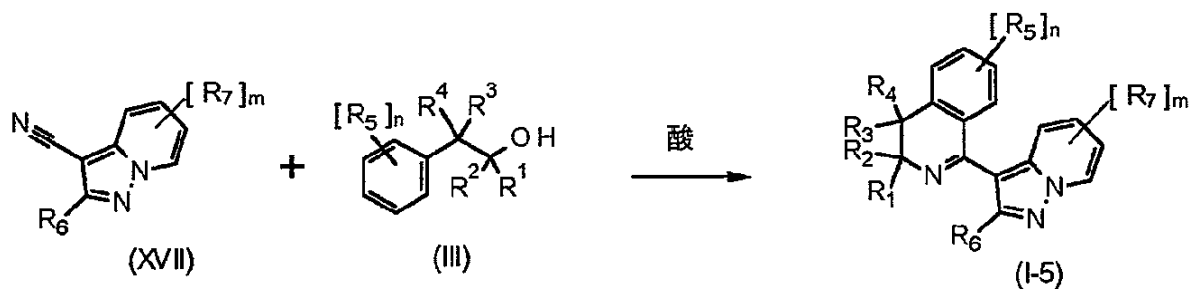
【0156】

式I-5の化合物(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 および m および n は、式Iの化合物について定義されているとおりである)は、式IIIの化合物(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物について定義されているとおりである)を伴う、例えば硫酸、トリフルオロ酢酸またはトリフルオロメタンスルホン酸による酸性条件下における、式XVIIの化合物(式中、 R_6 、 R_7 および m は式Iの化合物について定義されているとおりである)の変換により得ることが可能である。これはスキーム13に示されている。

20

【化28】

スキーム13



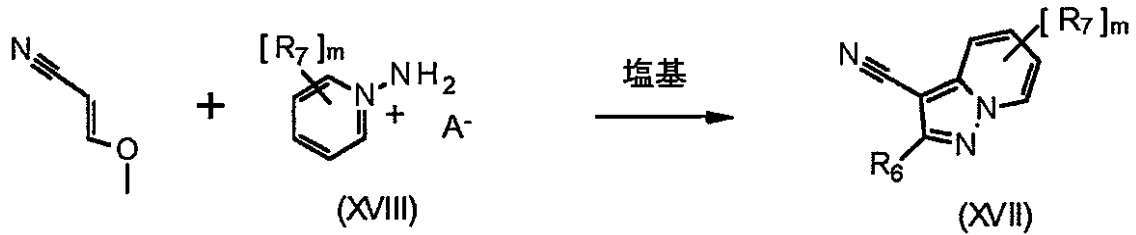
30

【0157】

式XVIIの化合物(式中、 R_6 、 R_7 および m は、式(I)の化合物について定義されているとおりである)は、公知の方法(例えば:A. Kakehi et al Chemical & Pharmaceutical Bulletin, 1987, 35, 156-169; P. Gmeiner and J. Schunemann Archiv de Pharmazie 1988, 321, 517-20を参照のこと)により得ることが可能である。一例として、化合物XVIIは、3-メトキシプロパ-2-エニトリルと、式XVIIのN-アミノピリジニウム塩(これは、市販されているか、または、公知の方法により得ることが可能である)(式中、 R^7 および m は、式(I)について定義されているとおりであり、ならびに、アニオン A^- は異なる性質(例えば、ヨウ化物または2,4,6-トリメチルベンゼンスルホネート)のものであることが可能である)との、例えば炭酸カリウムといった塩基の存在下における反応により調製可能である。これはスキーム14に示されている。

40

【化29】

スキーム14

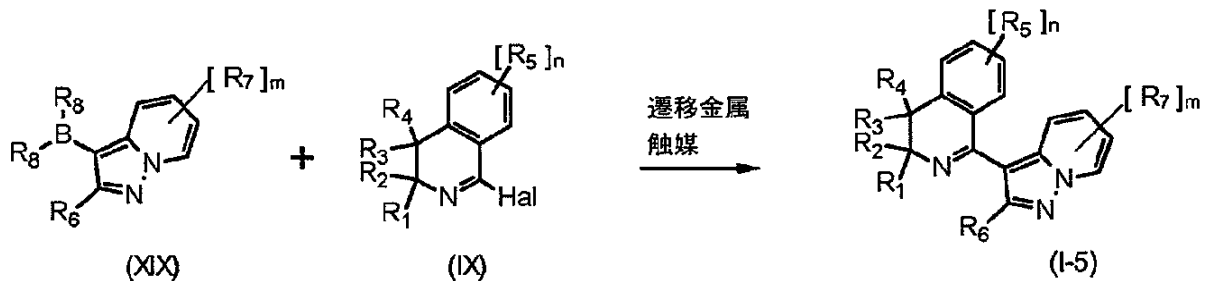
10

【0158】

式I-5の化合物(式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆、R₇およびmおよびnは、式Iの化合物について定義されているとおりである)は、式IXの化合物(式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅およびnは、式(I)の化合物について定義されているとおりであり、ならびに、Halは、好ましくはクロロまたはブロモといったハロゲンである)を伴う、鈴木-宮浦反応条件下における、式XIXの化合物(式中、R₆、R₇およびmは、式(I)の化合物について定義されているとおりであり、ならびに、R₈はヒドロキシルであるか、または、2個のR⁸が介在するホウ素原子と一緒に5員もしくは6員飽和複素環を形成している)の変換により得ることが可能である。これはスキーム15に示されている。

20

【化30】

スキーム15

30

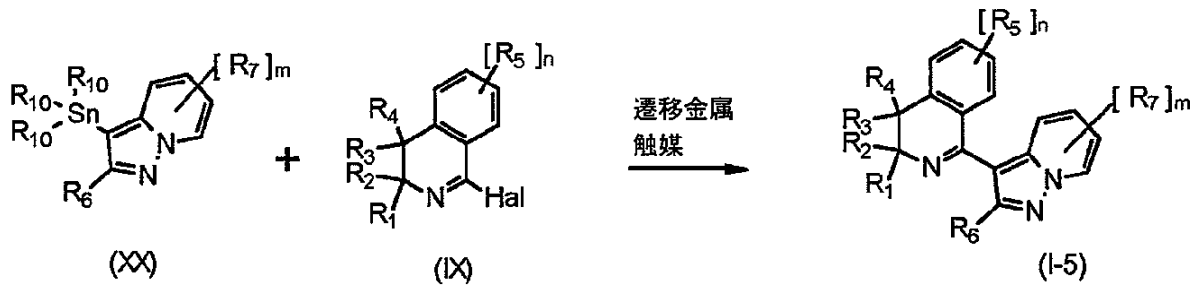
【0159】

あるいは、式I-5の化合物(式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆、R₇およびmおよびnは、式Iの化合物について定義されているとおりである)は、式IXの化合物(式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅およびnは、式(I)の化合物について定義されているとおりであり、ならびに、Halは、好ましくはクロロまたはブロモといったハロゲンである)を伴う、スティル反応条件下における、式XXの化合物(式中、R₆、R₇およびmは、式(I)の化合物について定義されているとおりであり、ならびに、R₁₀はC₁~C₆アルキルである)の変換により得ることが可能である。これはスキーム16に示されている。

40

【化31】

スキーム16



10

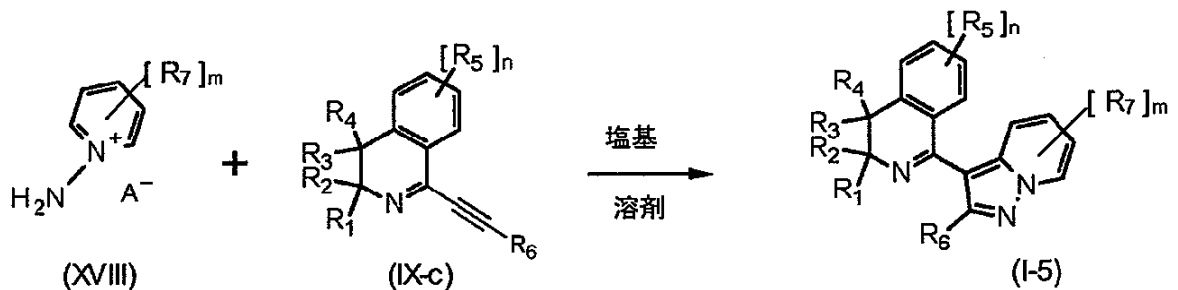
【0160】

あるいは、式I-5の化合物(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 および m および n は、式Iの化合物について定義されているとおりである)は、式IX-cの化合物(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 および n は式Iの化合物について定義されているとおりである)を、式XVIIの化合物(式中、 A^- は、スキーム14において定義されているとおりであり、 R_7 および m は式Iの化合物について定義されているとおりである)で、炭酸カリウムなどの塩基の存在下に、ジメチルホルムアミドなどの不活性溶剤中において処理することにより得ることが可能である。これはスキーム17に示されている。

20

【化32】

スキーム17



30

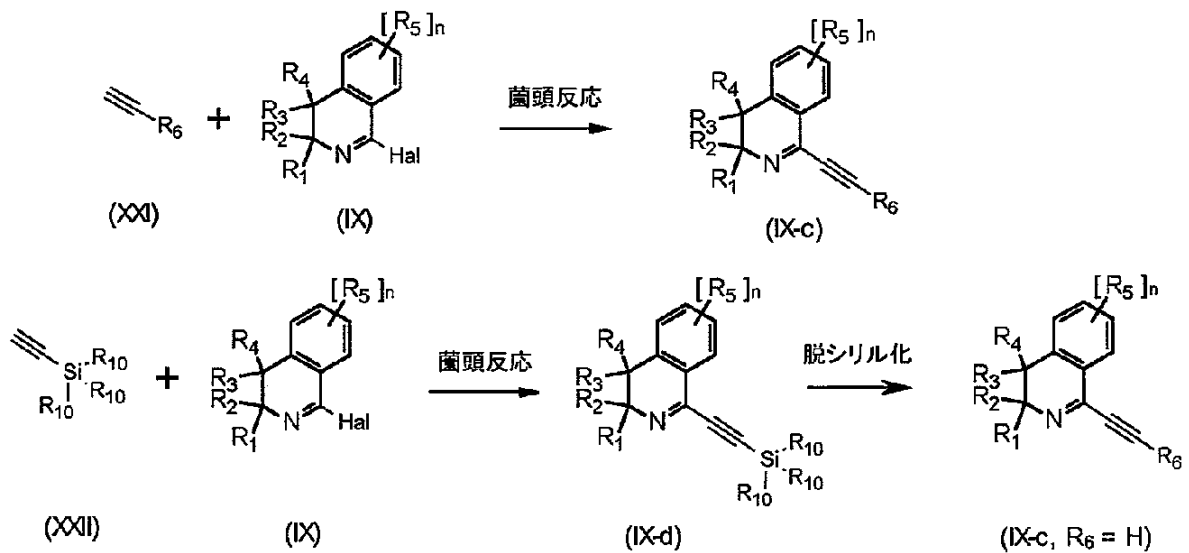
【0161】

式IX-cの化合物(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 および n は、式Iの化合物について定義されているとおりである)は、式IXの化合物(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は、式(I)の化合物について定義されているとおりであり、ならびに、 Hal は、好ましくはクロロまたはブロモといったハロゲンである)を、式XXIの化合物(式中、 R_6 は、式(I)の化合物について定義されているとおりである)で、菌頭反応条件下において処理することにより得ることが可能である。式IX-cの化合物(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は、式(I)の化合物について定義されているとおりであり、ならびに、 R_6 はHである)に関して、上記の菌頭反応は、好ましくは、式XXIIの化合物(式中、 R_{10} は $C_1 \sim C_6$ アルキルである)により式IX-dの化合物(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は、式(I)の化合物について定義されているとおりであり、ならびに、 R_{10} は $C_1 \sim C_6$ アルキルである)を得、続いて、メタノールなどのアルコール溶剤中における炭酸カリウムなどの当業者に周知である条件下において脱シリル化することによって行われる。これはスキーム18に示されている。

40

【化33】

スキーム18



10

【0162】

式 I - c の化合物 (式中、R₃ および R₄ はフルオロであり、ならびに、Q₁、Q₂、R₁、R₂、R₅、R₆、R₇、m および n は式 I の化合物について定義されているとおりである) は、三フッ化ジエチルアミノ硫黄 (DAST) もしくは 2, 2 - ジフルオロ - 1, 3 - ジメチル - イミダゾリジン (DFI) のフッ素化試薬をそのまま、または、溶剤の存在下で伴って、加熱を伴う、式 I - d の化合物 (式中、R₃ および R₄ は、これらが結合している炭素原子と一緒に C=O を表し、ならびに、Q₁、Q₂、R₁、R₂、R₅、R₆、R₇、m および n は、式 (I) について定義されているとおりである) の変換により得ることが可能である。これはスキーム 19 に示されている。

20

【化34】

スキーム19



30

40

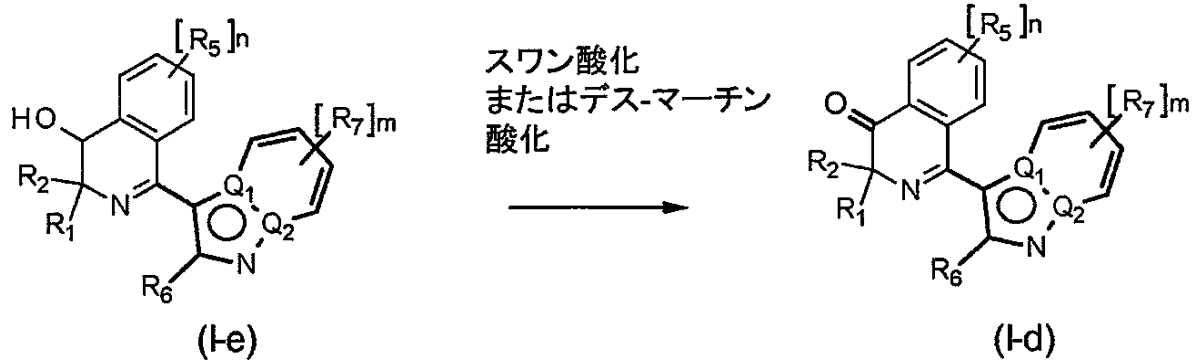
【0163】

式 I - d の化合物 (式中、R₃ および R₄ は、これらが結合している炭素原子と一緒に C=O を表し、ならびに、Q₁、Q₂、R₁、R₂、R₅、R₆、R₇、m および n は式 I について定義されているとおりである) は、1, 1, 1 - トリアセトキシ - 1, 1 - ジヒドロ - 1, 2 - ベンゾイオドキシソール 3 (1H) - オン (デス・マーチン・ペルヨージナン) などの酸化剤による、または、塩化オキサリル、ジメチルスルホキシド (DMSO) とトリエチルアミン (スワン酸化) などの有機塩基とを用いる、式 I - e の化合物 (式中、R₃ は水素であり、ならびに、R₄ はヒドロキシであり、ならびに、Q₁、Q₂、R₁、R₂、R₅、R₆、R₇、m および n は、式 (I) について定義されているとおりである) の変換により得ることが可能である。これはスキーム 20 に示されている。

50

【化35】

スキーム20



10

【0164】

式I-eの化合物(式中、R₃は水素であり、ならびに、R₄はヒドロキシであり、ならびに、Q₁、Q₂、R₁、R₂、R₅、R₆、R₇、mおよびnは、式Iについて定義されているとおりである)は、水性K₂CO₃などの加水分解条件下における、式I-fの化合物(式中、R₃は水素であり、および、R₄は、プロモまたはクロロなどのハロゲン(hal)であり、ならびに、Q₁、Q₂、R₁、R₂、R₅、R₆、R₇、mおよびnは、式(I)について定義されているとおりである)の変換により得ることが可能である。これはスキーム21に示されている。

20

【化36】

スキーム21



30

【0165】

式I-fの化合物(式中、R₃は水素であり、および、R₄は、プロモまたはクロロなどのハロゲン(hal)であり、および、Q₁、Q₂、R₁、R₂、R₅、R₆、R₇、mおよびnは、式Iについて定義されているとおりである)は、N-プロモスクシンイミド(NBS)またはN-クロロスクシンイミドまたは1,3-ジブromo-5,5-ジメチルヒダントインなどのハロゲン化剤を伴う、アゾビスイソブチロニトリル(AIBN)などのラジカル開始剤の存在下における、式I-gの化合物(式中、R₃およびR₄は水素であり、および、Q₁、Q₂、R₁、R₂、R₅、R₆、R₇、mおよびnは、式(I)について定義されているとおりである)の変換により得ることが可能である。これはスキーム22に示されている。

40

【化37】

スキーム22



10

【0166】

式I-gの化合物は、スキーム1、3、4、12、14および15に記載の方法に従って得ることが可能である。

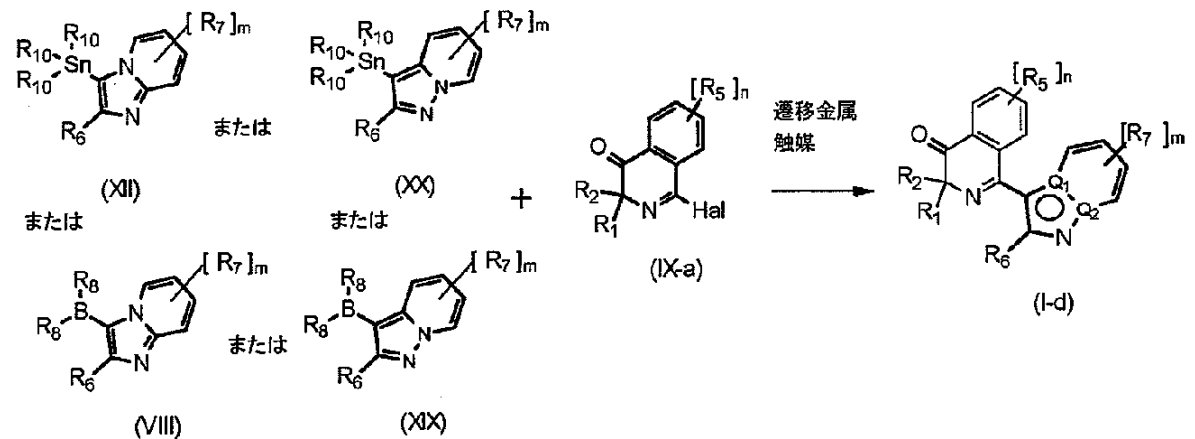
【0167】

あるいは、式I-dの化合物(式中、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒に $C=O$ を表し、ならびに、 Q_1 、 Q_2 、 R_1 、 R_2 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は、式Iについて定義されているとおりである)は、式IX-aの化合物(式中、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒に $C=O$ を表し、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_5 および n は、式(I)の化合物について定義されているとおりであり、ならびに、Halは、好ましくはクロロまたはプロモといったハロゲンである)を伴う、鈴木-宮浦反応またはスチール反応条件下における、式VIIIまたはXIIまたはXIXまたはXXの化合物(式中、 R_6 、 R_7 および m は、式(I)の化合物について定義されているとおりであり、ならびに、 R_8 はヒドロキシルであるか、または、2個の R_8 が介在するホウ素原子と一緒に 5 員もしくは 6 員飽和複素環を形成しており、または、 R_{10} は $C_1 \sim C_6$ アルキルである)の変換により得ることが可能である。これはスキーム23に示されている。

20

【化38】

スキーム23



40

【0168】

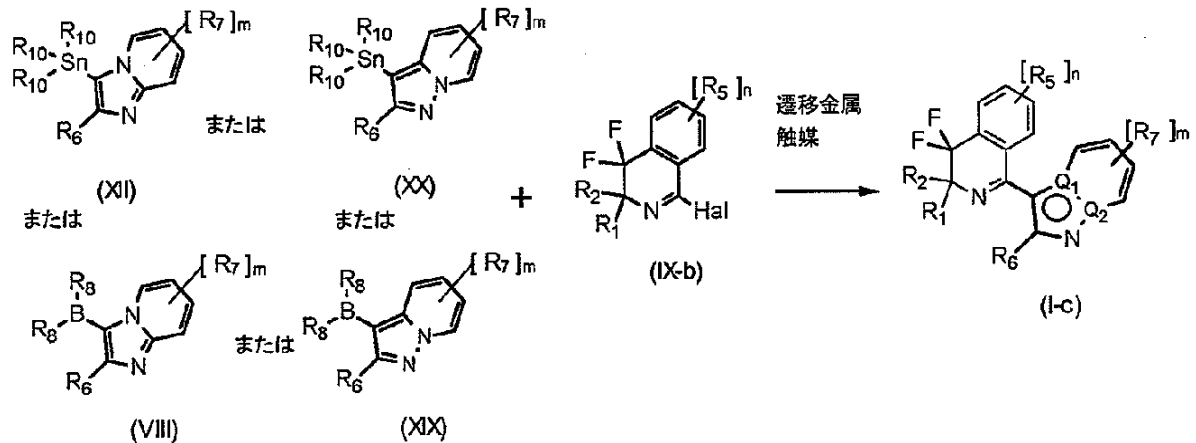
あるいは、式I-cの化合物(式中、 R_3 および R_4 はフルオロであり、ならびに、 Q_1 、 Q_2 、 R_1 、 R_2 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は式Iの化合物について定義されているとおりである)は、式IX-bの化合物(式中、 R_3 および R_4 はフルオロであり、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_5 および n は、式(I)の化合物について定義されているとおりであり、

50

ならびに、Halは、好ましくはクロロまたはプロモといったハロゲンである)を伴う、鈴木-宮浦反応またはスチール反応条件下における、式VIIまたはXIIまたはXIXまたはXXの化合物(式中、 R_6 、 R_7 および m は、式(I)の化合物について定義されているとおりであり、ならびに、 R_8 はヒドロキシルであるか、または、2個の R_8 が介在するホウ素原子と一緒に5員もしくは6員飽和複素環を形成しており、または、 R_{10} は $C_1 \sim C_6$ アルキルである)の変換により得ることが可能である。これはスキーム24に示されている。

【化39】

スキーム24



10

20

【0169】

式IX-aおよびIX-bの化合物は、式Xの化合物(式中、 R_3 および R_4 は水素であり、および、 R_1 、 R_2 、 R_5 および n は、式Iの化合物について定義されているとおりである)から出発して、スキーム20、21および22と同様に調製可能である。

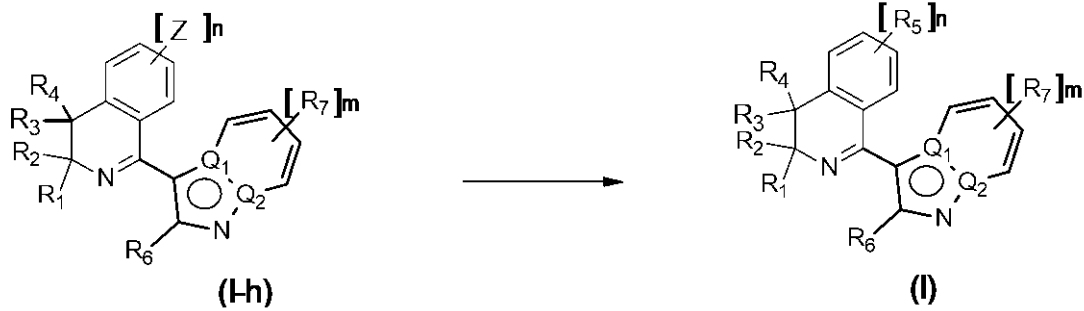
【0170】

あるいは、式Iの化合物(式中、 Q_1 、 Q_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は式Iの化合物に定義されているとおりである)は、溶剤中、塩基の存在下または不在下、ならびに、カップリング試薬および金属触媒の存在下における、式I-hの化合物(式中、 Q_1 、 Q_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_6 、 R_7 、 m および n は式(I)に定義されているとおりであり、Zは塩素、臭素またはヨウ素を表す)の変換により得ることが可能である。カップリング剤、触媒、溶剤および塩基は、“Cross-Coupling Reactions: A Practical Guide (Topics in Current Chemistry)”, edited by Norio Miyaura and S.L. Buchwald (editions Springer)、または、“Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions”, edited by Armin de Meijere and Francois Diederich (editions WILEY-VCH)に記載のものなどの通常のカップリング反応に用いられるものである限り、特に限定されない。これをスキーム25に示す。

30

40

【化40】

スキーム25

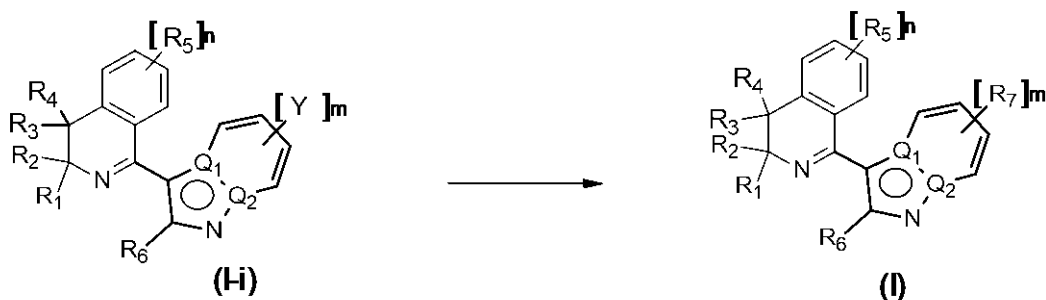
10

【0171】

あるいは、式Iの化合物(式中、 Q_1 、 Q_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は式Iの化合物に定義されているとおりである)は、溶剤中、塩基の存在下または不在下、ならびに、カップリング試薬および金属触媒の存在下における、式I-iの化合物(式中、 Q_1 、 Q_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 m および n は式Iの化合物に定義されているとおりであり、 Y は塩素、臭素またはヨウ素を表す)の変換により得ることが可能である。カップリング剤、触媒、溶剤および塩基は特に限定されず、“Cross-Coupling Reactions: A Practical Guide (Topics in Current Chemistry)”, edited by Norio Miyaura und S.L. Buchwald (editions Springer)、または、“Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions”, edited by Armin de Meijere and Francois Diederich (editions WILEY-VCH)に記載のものなどの通常のカップリング反応において用いられるものである。これはスキーム26に示されている。

20

【化41】

スキーム26

30

【0172】

あるいは、一定の式(I)の化合物(式中、 Q_1 、 Q_2 、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は上記に定義されているとおりである)は、他の関連性の高い式I(またはその類似体)の化合物の当業者に公知である標準的な合成技術を用いる変換により得ることが可能である。網羅的ではないが、例としては、酸化反応、還元反応、加水分解反応、カップリング反応、芳香族求核性または求電子性置換反応、求核置換反応、求核性付加反応およびハロゲン化反応が挙げられる。

40

【0173】

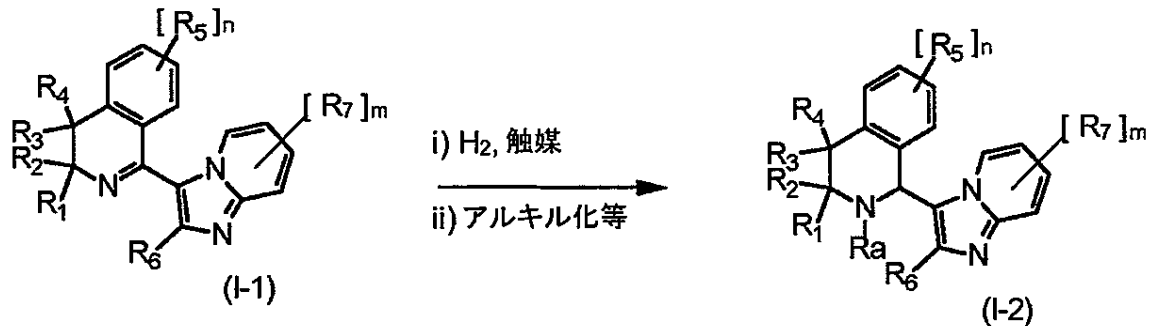
式I-2およびI-6の化合物(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_a 、 m および n は式Iの化合物について定義されているとおりである)は、例えば水素および触媒を伴う還元性反応条件下における、式I-1またはI-5の化合物(式中、 R_1 、 R_2 、

50

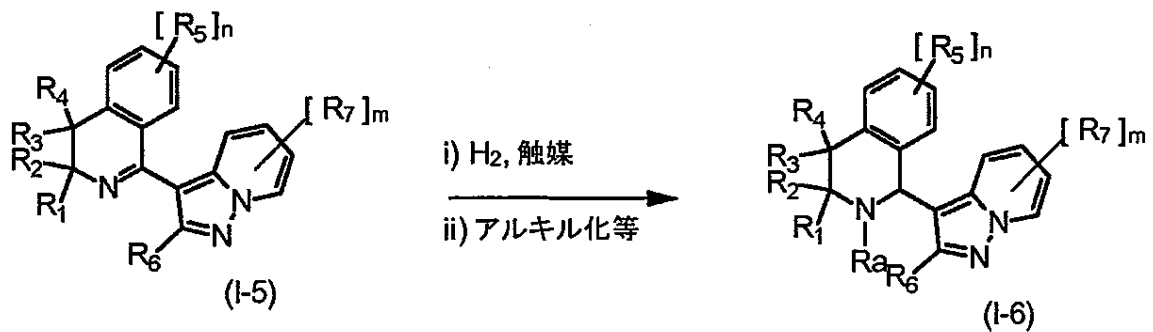
R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は式Iの化合物について定義されているとおりである)の変換により得ることが可能である。式I-2およびI-6の化合物におけるテラヒドロイソキノリンの環窒素($R^a = H$ である場合)は、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲン化アルキルおよび塩基を伴う反応によってさらにアルキル化されることが可能であり($R_a = C_1 \sim C_6$ アルキルが得られる)、または、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルハライドおよび塩基を伴う変換によってアシル化されることが可能である($R_a = C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルが得られる)。これはスキーム27に示されている。

【化42】

スキーム27



10



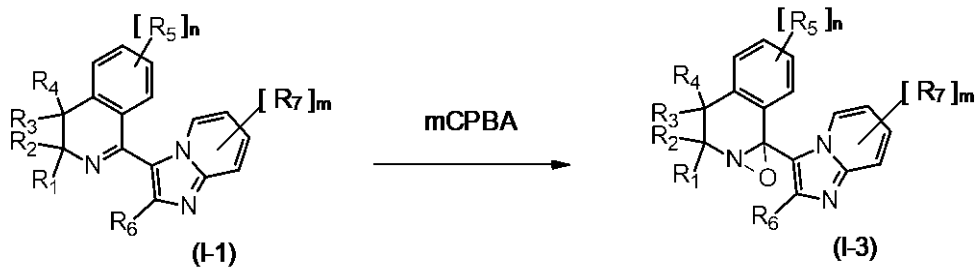
20

30

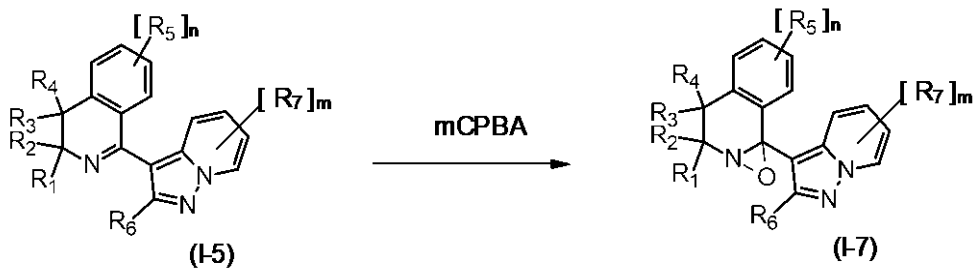
【0174】

式I-3および1-7の化合物(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は、式Iの化合物について定義されているとおりである)は、例えばメタクロロ過安息香酸といった酸化性反応条件下における、式I-1または1-5の化合物(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は式Iの化合物について定義されているとおりである)の変換により得ることが可能である。これはスキーム28に示されている。

【化43】

スキーム28

10

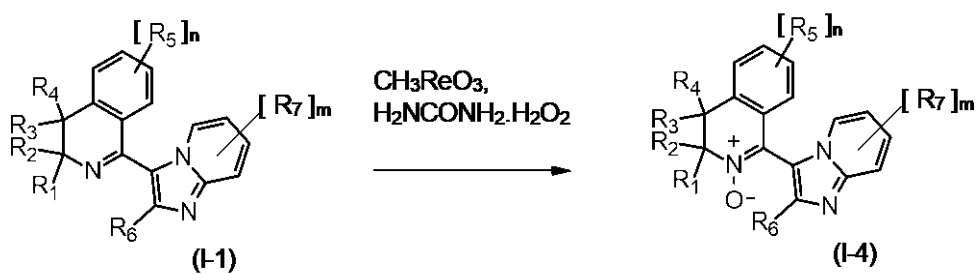


20

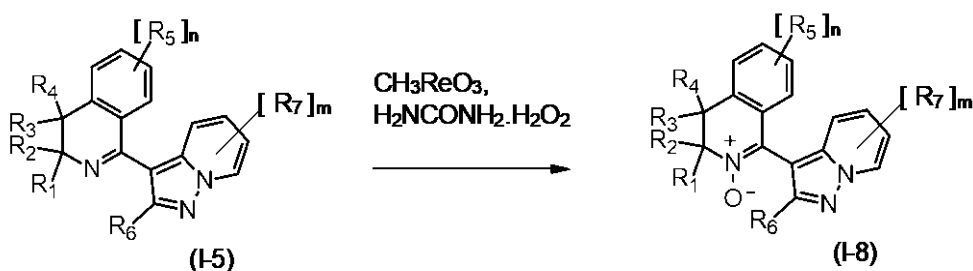
【0175】

式 I - 4 および I - 8 の化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は式 I の化合物について定義されているとおりである）は、例えばメチルトリオキソレニウムおよび尿素過酸化水素による酸化性反応条件下における、式 I - 1 または 1 - 5 の化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は、式 I の化合物について定義されているとおりである）の変換により得ることが可能である。これはスキーム 29 に示されている。

【化44】

スキーム29

30



40

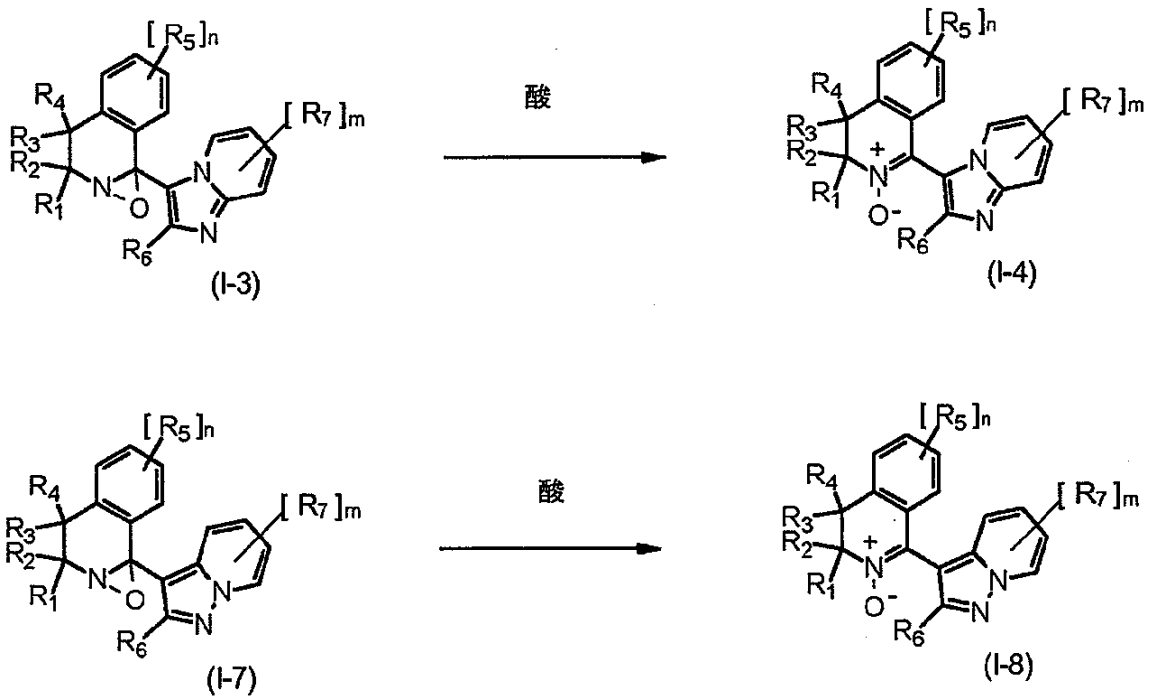
【0176】

50

あるいは、式 I - 4 および I - 5 の化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は、式 I の化合物について定義されているとおりである）は、例えばメタンスルホン酸を伴う酸性条件下における、式 I - 3 および I - 7 の化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は、式 I の化合物について定義されているとおりである）の変換により得ることが可能である。これはスキーム 30 に示されている。

【化 4 5】

スキーム 30



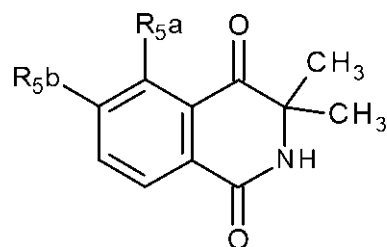
【0177】

上記のスキームに記載の一定の中間体は新規のものであり、従って、本発明のさらなる態様を構成する。

【0178】

新規の中間体の一類は、式 (XA) の化合物

【化 4 6】



(XA)

（式中、 R_{5a} はフルオロまたは水素であり；および、 R_{5b} はフルオロまたは水素である）、および、式 (XB) の化合物

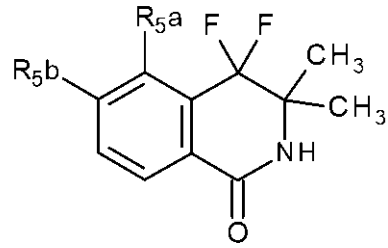
10

20

30

40

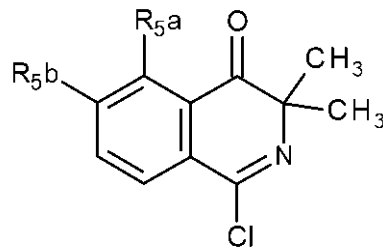
【化 4 7】



(XB)

(式中、 R_{5a} はフルオロまたは水素であり；および、 R_{5b} はフルオロまたは水素である)、および、式 (XC) の化合物 10

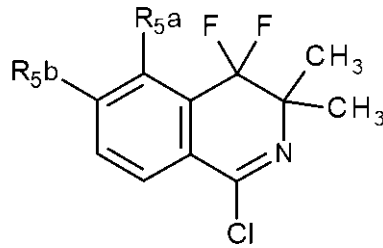
【化 4 8】



(XC)

(式中、 R_{5a} はフルオロまたは水素であり；および、 R_{5b} はフルオロまたは水素である)、および、式 (XD) の化合物 20

【化 4 9】



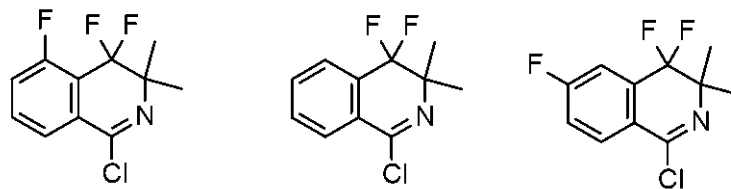
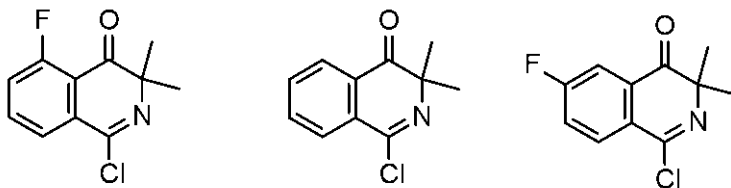
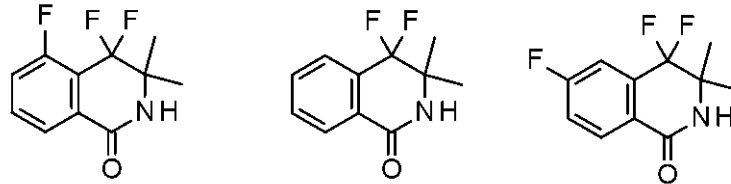
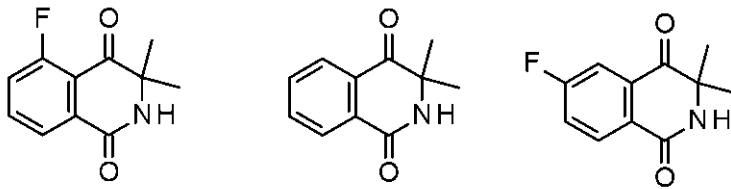
(XD)

(式中、 R_{5a} はフルオロまたは水素であり；および、 R_{5b} はフルオロまたは水素である)
である。

【 0 1 7 9】

特に好ましい新規の中間体は以下のものである。

【化50】



10

20

【0180】

式(I)の化合物は、農業部門および関連する使用分野において、例えば、植物有害生物または非生体材料の防除、ヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物もしくは生物の防除に係る活性成分として用いられることが可能である。新規化合物は、低施用量での優れた活性、植物による優れた耐容性、および、環境に対して安全であることにより際だって優れたものである。これらはきわめて有用な治療的特性、予防的特性および浸透移行特性を有すると共に、数多くの栽培植物の保護に用いられ得る。式(I)の化合物は、有用な植物の異なる作物の植物または植物の一部(果実、花、葉、茎、塊茎、根)に生じる有害生物を阻害または駆除するために、他方では、同時に、後に成長する植物のこれらの部位をも例えば植物病原性微生物から保護するために用いられることが可能である。

30

【0181】

式(I)の化合物を殺菌・殺カビ剤(fungicide)として用いることも可能である。「殺菌・殺カビ剤」という用語は、本明細書において用いられるところ、真菌の増殖を防除し、変性させ、または、防止する化合物を意味する。「殺菌・殺カビ的に(fungicidally)有効な量」という用語は、真菌の増殖に効果をもたらすことが可能である、このような化合物またはこのような化合物の組み合わせの量を意味する。防除または変性効果は、死滅、遅滞等などの自然の発育からの逸脱のすべてを含み、予防は、真菌による感染を予防するための植物におけるバリアまたは他の防御形成を含む。

40

【0182】

土壤中で発生する真菌性感染症、ならびに、植物病原性真菌に対する保護のために、例えば果実、塊茎もしくは穀粒などの種子または植物挿穂(例えばイネ)といった植物繁殖

50

体を処理する粉衣剤として式(I)の化合物を用いることも可能である。この繁殖体は、植え付け前に式(I)の化合物を含む組成物で処理することが可能である：例えば、種子は、播種される前に粉衣されることが可能である。式(I)の化合物はまた、種子を液体配合物中に含浸させるか、または、種子を固体配合物でコーティングすることにより穀粒に適用(コーティング)することが可能である。組成物はまた、繁殖体が植え付けられる際に植え付け箇所に適用が可能であり、例えば、播種の最中において蒔き溝に適用が可能である。本発明はまた、このような植物繁殖体の処理方法、および、このようにして処理された植物繁殖体にも関する。

【0183】

さらに、本発明に係る化合物は、例えば、木材および木材系工業用製品を含む工業用材料の保護、食品保管、衛生管理といった関連する分野における真菌の防除に用いられることが可能である。

10

【0184】

加えて、本発明は、例えば材木、壁板および塗料といった非生体材料を真菌による作用から保護するために用いられることが可能である。

【0185】

これらを含む式(I)の化合物および殺菌・殺カビ組成物を用いて、広範囲の真菌性植物病原体によって引き起こされる植物病害を防除し得る。これらは、観賞用作物、芝生、野菜、農作物、穀類および果実作物の葉病原体などの広範囲の植物病害の防除において効果的である。

20

【0186】

防除され得る、これらの病害に係る真菌および真菌媒介物、ならびに、植物病原性バクテリアおよびウイルスは、例えば以下のとおりである。

アブシジアコリムビフェラ(*Absidia corymbifera*)、アルテルナリア属の一種(*Alternaria spp.*)、アフアノミセス属の一種(*Aphanomyces spp.*)、アスコキタ属の一種(*Ascochyta spp.*)、A.フラバス(*A. flavus*)、A.フミガーツス(*A. fumigatus*)、A.ニズランス(*A. nidulans*)、A.ニガー(*A. niger*)、A.テルス(*A. terrus*)を含むアスペルギルス属の一種(*Aspergillus spp.*)、A.プルランス(*A. pullulans*)を含むアウレオバシジウム属の一種(*Aureobasidium spp.*)、ブラストミセスデルマチチディス(*Blastomyces dermatitidis*)、ブルメリアグラミニス(*Blumeria graminis*)、ブレミアラクツカエ(*Bremia lactucae*)、B.ドチデア(*B. dothidea*)、B.オブツサ(*B. obtusa*)のボトリオスファエリア属の一種(*Botryosphaeria spp.*)、B.シネレア(*B. cinerea*)を含むボトリチス属の一種(*Botrytis spp.*)、C.アルビカンス(*C. albicans*)、C.グラブラータ(*C. glabrata*)、C.クルセイ(*C. krusei*)、C.ルシタニエ(*C. lusitaniae*)、C.パラプシロシス(*C. parapsilosis*)、C.トロピカリス(*C. tropicalis*)のカンジダ属の一種(*Candida spp.*)、セファロアスクスフラグランス(*Cephaloascus fragrans*)、セラトシスチス属の一種(*Ceratocystis spp.*)、C.アラキジコラ(*C. arachidicola*)を含むセルコスボラ属の一種(*Cercospora spp.*)、セルコスボリジウムペルソナツム(*Cercosporidium personatum*)、クラドスポリウム属の一種(*Cladosporium spp.*)、クラビセプスブルブレア(*Claviceps purpurea*)、

30

40

コクシジオイデスイミティス(*Coccidioides immitis*)、コクリオボルス属の一種(*Cochliobolus spp.*)、C.ムサエ(*C. musae*)を含むコレトトリカム属の一種(*Colletotrichum spp.*)、

クリプトコッカスネオフォルマン(*Cryptococcus neoforman*)

50

s)、ジアポルテ属の一種(*Diaporthe* spp)、ジディメラ属の一種(*Didymella* spp)、ドレックスレラ属の一種(*Drechslera* spp)、エルシノエ属の一種(*Elsinoe* spp)、

エピデルモフィトン属の一種(*Epidermophyton* spp)、エルウィニアアミロボラ(*Erwinia amylovora*)、E.シコラセアルム(*E. cichoracearum*)を含むエリシフェ種(*Erysiphe* spp.)、

ユーチバラタ(*Eutypa lata*)、F.クルモルム(*F. culmorum*)、F.グラミネアルム(*F. graminearum*)、F.ラングセチエ(*F. langsethiae*)、F.モニリホルム(*F. moniliforme*)、F.オキシスポルム(*F. oxysporum*)、F.プロリフェラツム(*F. proliferatum*)、F.スブグルチナンス(*F. subglutinans*)、F.ソラニ(*F. solani*)を含むフザリウム属の一種(*Fusarium* spp.)、ゲーウマノミセスグラミニス(*Gaeumannomyces graminis*)、ギベレラフジク

ロイ(*Gibberella fujikuroi*)、グロエオデスポミゲナ(*Gloeodes pomigena*)、グロエオスポリウムムサルム(*Gloeosporium musarum*)、グロメレラシングレート(*Glomerella cingulate*)、ガイグナルディアビドウェリイ(*Guignardia bidwellii*)、ギムノスポランギウム ジュニペリ-ヴィルギニアネ(*Gymnosporangium juniperi-virginianae*)、ヘルミントスポリウム属の一種(*Helminthosporium* spp)、ヘミレイア属の一種(*Hemileia* spp)、H.カプスラツム(*H. capsulatum*)を含むヒストプラズマ属の

一種(*Histoplasma* spp.)、ラエチサリアフシホルミス(*Laetisaria fuciformis*)、レプトグラフィウムリンドベルギ(*Leptographium lindbergi*)、レveilラタウリカ(*Leveillula taurica*)、ロフォデルミウムセディチオスム(*Lophodermium seditiosum*)、コムギ赤かび病菌(*Microdochium nivale*)、ミクロスポルム属の一種(*Microsporum* spp)、モニリニア属の一種(*Monilinia* spp)、ムコール属の一種(*Mucor* spp)、コムギ葉枯病菌(*M. graminicola*)、M.ポミ(*M. pomi*)を含むミコスファエレラ属の

一種(*Mycosphaerella* spp.)、オンコバシジウムテオブロマエオン(*Oncobasidium theobromaenon*)、オフィオストマピセエ(*Ophiostoma piceae*)、パラコジディオイデス属の一種(*Paracoccidioides* spp)、P.ディジタツム(*P. digitatum*)、P.イタリクム(*P. italicum*)を含むペニシリウム属の一種(*Penicillium* spp.)、ペトリエリジウム属の一種(*Petriellidium* spp)、P.メイディス(*P. maydis*)、P.フィリピネンシス(*P. philippinensis*)およびP.ソルギ(*P. sorghi*)を含むペロノスクレロスポラ属の

一種(*Peronosclerospora* spp.)、ペロノスポラ属の一種(*Peronospora* spp)、コムギふ枯病菌(*Phaeosphaeria nodorum*)、ファコプソラパチリジ(*Phakopsora pachyrhizi*)、フェリヌスイグニアルス(*Phellinus igniarius*)、フィアロフォラ属の

一種(*Phialophora* spp)、フォーマ属の一種(*Phoma* spp)、ホモプシスピティコーラ(*Phomopsis viticola*)、P.インフェスタンス(*P. infestans*)を含むフィトフトラ属の一種(*Phytophthora* spp.)、P.ハルステジイ(*P. halstedii*)、P.ピチコラ(*P. viticola*)を含むプラスモパラ属の一種(*Plasmopara* spp.)、プレオスポラ属の

一種(*Pleospora* spp.)、リンゴうどんこ病菌(*Ploucotricha*)を含むポドスファエラ属の一種(*Podosphaera* spp.)、ポリミキサグラミニス(*Polymyxa graminis*)、ポリミキサベ

タエ(*Polymyxa betae*)、シュードセルコスボレラヘルボトリコイド(P

10

20

30

40

50

seudocercospora herpotrichoides)、シュードモナス属の一種 (*Pseudomonas* spp)、*P. cubensis*、*P. fumuli* を含むシュードペロノスポラ属の一種 (*Pseudoperonospora* spp.)、シュードペジザトラケイフィラ (*Pseudopeziza tracheiphila*)、*P. hordei*、*P. recondita*、*P. striiformis*、*P. tritricina* を含むブッシニア属の一種 (*Puccinia* spp.)、ピレノペジザ属の一種 (*Pyrenopeziza* spp)、ピレノフォラ属の一種 (*Pyrenophora* spp)、イネいもち病菌 (*P. oryzae*) を含むピリクラリア属の一種 (*Pyricularia* spp) 10
P. ultimum を含むピシウム属の一種 (*Pythium* spp.)、ラムラリア属の一種 (*Ramularia* spp)、リゾクトニア属の一種 (*Rhizoctonia* spp)、リゾムコールプシルス (*Rhizomucor pusillus*)、リゾプスアリズス (*Rhizopus arrhizus*)、リンコスפורリウム属の一種 (*Rhynchosporium* spp)、*S. apiospermum* および *S. proliferans* を含むセドスפורリウム属の一種 (*Scedosporium* spp.)、スキゾチリウムポミ (*Schizothyrium pomi*)、

スクレロチニア属の一種 (*Sclerotinia* spp)、スクレロチウム属の一種 (*Sclerotium* spp)、*S. nodorum*、*S. tritici* を含むセプトリア属の一種 (*Septoria* spp) 20
Sphaerotheca macularis、*Sphaerotheca fusca* (*Sphaerotheca fuliginea*)、スポロトリクス属の一種 (*Sporothrix* spp)、スタゴノスポラノドルム (*Stagonospora nodorum*)、ステムフィリウム属の一種 (*Stemphylium* spp.)、ステレウムヒルスツム (*Stereum hirsutum*)、タナテホルスクケメリス (*Thanatephorus cucumeris*)、チエラビオプシスバシコラ (*Thielaviopsis basicola*)、チレチア属の一種 (*Tilletia* spp)、*T. harzianum*、*T. pseudokoningii*、*T. viride* を含むトリコデルマ属の一種 (*Trichoderma* spp.)、

トリコフィトン属の一種 (*Trichophyton* spp)、チフラ属の一種 (*Typhula* spp)、ウンシヌラネカトル (*Uncinula necator*)、ウロシスチス (*Urocystis* spp)、ウスチラゴ属の一種 (*Ustilago* spp)、*V. inaequalis* を含むベンチュリア属の一種 (*Venturia* spp.)、ベルチシリウム属の一種 (*Verticillium* spp) およびキサントモナス属の一種 (*Xanthomonas* spp)。
 【0187】

特に、これらを含む式 (I) の化合物および殺菌・殺カビ組成物を用いて、担子菌綱 (*Basidiomycete*)、子嚢菌綱 (*Ascomycete*)、卵菌綱 (*Oomycete*) および / または不完全菌類、ブラソクラディオマイセート (*Blasocladiomycete*)、ツボカビ綱 (*Chytridiomycete*)、グロムス門 (*Glomeromycete*) および / またはケカビ綱 (*Mucoromycete*) における広範囲の真菌性植物病原体によって引き起こされる植物病害を防除し得る。
 【0188】

これらの病原体としては以下が挙げられ得る。

卵菌綱 (*Oomycete*) であって、以下を含む。フィトフトラカプシシ (*Phytophthora capsici*)、フィトフトラインフェスタンス (*Phytophthora infestans*)、フィトフトラソヤエ (*Phytophthora* 50

sojae)、フィトフトラフラガリエ(*Phytophthora fragariae*)、フィトフトラニコチアネ(*Phytophthora nicotianae*)、フィトフトラシンナモミ(*Phytophthora cinnamomi*)、フィトフトラシトリコラ(*Phytophthora citricola*)、フィトフトラシトロフトラ(*Phytophthora citrophthora*)およびフィトフトラエリトロセプチカ(*Phytophthora erythroseptica*)によって引き起こされるものなどのフィトフトラ(*Phytophthora*)病害;ピシウムアファニデルマツム(*Pythium aphanidermatum*)、ピシウムアレノマネス(*Pythium arrhenomanes*)、ピシウムグラミニコラ(*Pythium graminicola*)、ピシウムイレグラレ(*Pythium irregulare*)およびピシウムウルチマム(*Pythium ultimum*)によって引き起こされるものなどのピシウム(*Pythium*)病害;ペロノスポラデストラクトル(*Peronospora destructor*)、ペロノスポラパラシティカ(*Peronospora parasitica*)、プラズモパラピチコーラ(*Plasmopara viticola*)、プラズモパラハルステジイ(*Plasmopara halstedii*)、シュードペロノスポラクベンシス(*Pseudoperonospora cubensis*)、アルブゴカンジダ(*Albugo candida*)、スクレログトラマクロスポラ(*Sclerophthora macrospora*)およびブレミアラクツカエ(*Bremia lactucae*)などのツユカビ目(*Peronosporales*)によって引き起こされる病害;ならびに、アファノミセスコクリオイデス(*Aphanomyces cochlioides*)、ラビリンツラゾステラエ(*Labyrinthula zosteriae*)、ペロノスクレロスポラソルギ(*Peronosclerospora sorghi*)およびスクレロスポラグラミニコラ(*Sclerospora graminicola*)などの他のもの。

【0189】

子囊菌綱(*Ascomycetes*)であって、例えば、ステムフィリウムソラニ(*Stemphylium solani*)、スタゴノスポラタイナネンシス(*Stagonospora tainanensis*)、スピロカエアオレアギネア(*Spilocaea oleaginea*)、セトスファエリアツルシカ(*Setosphaeria turcica*)、ピレノカエタリコペリシチ(*Pyrenochaeta lycoperisici*)、プレオスポラヘルバルム(*Pleospora herbarum*)、フォマデストラクティバ(*Phoma destructiva*)、ファエオスファエリアヘルボトリコイデス(*Phaeosphaeria herpotrichoides*)、ファエオクリプトクスガエウマンニイ(*Phaeocryptocus gaeumannii*)、オフィオスファエレラグラミニコラ(*Ophiosphaerella graminicola*)、オフィボルスグラミニス(*Ophiobolus graminis*)、レプトスファエリアマクランズ(*Leptosphaeria maculans*)、ヘンデルソニアクレベリマ(*Hendersonia creberrima*)、ヘルミントスポリウムトリティシレペンティス(*Helminthosporium tritici repentis*)、セトスファエリアツルシカ(*Setosphaeria turcica*)、ドレックスレラグリシネス(*Drechslera glycines*)、ジディメラブリオニエ(*Didymella bryoniae*)、シクロコニウムオレアギネウム(*Cycloconium oleagineum*)、コリネスポラカッシイコラ(*Corynespora cassiicola*)、コクリオボルスサチブス(*Cochliobolus sativus*)、ビボラリスカクティボラ(*Bipolaris cactivora*)、リンゴ黒星病菌(*Venturia inaequalis*)、ピレノホラテレス(*Pyrenophora teres*)、コムギ黄斑病菌(*Pyrenophora tritici-repentis*)、アルテルナリアアルテナタ(*Alternaria alternata*)、アルテルナリアブラッシシコラ(*Alternaria brassicicola*)、アルテルナリアソ

10

20

30

40

50

ラニ (*Alternaria solani*) およびアルテルナリアトマトフィラ (*Alternaria tomatophila*) などのプレオスポラ目 (*Pleosporales*); セプトリアトリティシ (*Septoria tritici*)、セプトリアノドルム (*Septoria nodorum*)、セプトリアグリシネス (*Septoria glycines*)、セルコスボラアラキディコーラ (*Cercospora arachidicola*)、セルコスボラソジナ (*Cercospora soja*)、セルコスボラセアエマイデイス (*Cercospora zeae-maydis*)、セルコスボレラカプセラエ (*Cercospora capsellae*) およびセルコスボレラヘルポトリコイデス (*Cercospora herpotrichoides*) などのカプノディウム目 (*Capnodiales*); クラドスポリウムカルポフィルム (*Cladosporium carpophilum*)、クラドスポリウムエフスム (*Cladosporium effusum*)、パッサロラフルバ (*Passalora fulva*)、クラドスポリウムオキシスポルム (*Cladosporium oxysporum*)、ドチストロマッセプトスポルム (*Dothistroma septosporum*)、イサリオブシスクラビスポラ (*Isariopsis clavisporea*)、マイコスファエレラフィジエンシス (*Mycosphaerella fijiensis*)、コムギ葉枯病菌 (*Mycosphaerella graminicola*)、マイコベロシエラコエプケイ (*Mycovellosiella koepkei*)、ファエオイサリオブシスバタチコラ (*Phaeoisariopsis bataticola*)、シュードセルコスボラビチス (*Pseudocercospora vitis*)、シュードセルコスボレラヘルポトリコイド (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、ラムラリアベチコラ (*Ramularia beticola*)、ラムラリアコロシグニ (*Ramularia collo-cygni*)、ゲーウマノミセスグラミニス (*Gaeumannomyces graminis*)、マグナポルテグリセア (*Magnaporthe grisea*)、イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) などのマグナポルテ目 (*Magnaporthales*); アニソグラマアノマラ (*Anisogramma anomala*)、アピオグノモニアエラブンダ (*Apiognomonium errabunda*)、サイトスポラプラタニ (*Cytospora platani*)、ジアポルテファセオロルム (*Diaporthe phaseolorum*)、ディスクラデストルクティバ (*Discula destructiva*)、グノモニアフルクティコーラ (*Gnomonia fructicola*)、グリネリアウビコーラ (*Greeneria uvicola*)、メランコニウムジュグランドイヌム (*Melanconium juglandinum*)、ホモブシスビティコーラ (*Phomopsis viticola*)、シロコッカスクラビギグネンティ - ジュグランドセアラム (*Sirococcus clavigignenti-juglandacearum*)、ツバキアドリイナ (*Tubakia dryina*)、ディカルペラ属の一種 (*Dicarpella* spp.)、バルサセラトスベルマ (*Valsa ceratosperma*) などのジアポルテ目 (*Diaportheales*); ならびに、アクチノチリウムグラミニス (*Actinothyrium graminis*)、アスコキタピシ (*Ascochyta pisi*)、アスペルギルスフラブス (*Aspergillus flavus*)、アスペルギルスフミガーツス (*Aspergillus fumigatus*)、アスペルギルスニズランス (*Aspergillus nidulans*)、アスペリスポリウムカリカエ (*Asperisporium caricae*)、ブルメリエラジャアピイ (*Blumeriella jaapii*)、カンジダ属の一種 (*Candida* spp.)、カプノジウムラモスム (*Capnodium ramosum*)、セファロアスクス属の一種 (*Cephaloascus* spp.)、セファロスポリウムグラミネウム (*Cephalosporium gramineum*)、セラトシスティスパラドクサ (*Ceratocystis paradoxa*)、キトミウム属の一種 (*Chaetomium* spp.)、ヒメノシフスシュードアルビツス (*Hymenos*

10

20

30

40

50

cyphus pseudoalbidus)、コッシデオイデス属の一種 (*Coccidioides spp.*)、シンドロスポリウムパディ (*Cylindrosporium padi*)、ジプロカルボンマラエ (*Diplocarpon malae*)、ドレパノペジザカンペストリス (*Drepanopeziza campestris*)、エルシノエアンペリナ (*Elsinoe ampelina*)、エピコッカムニグラム (*Epicoccum nigrum*)、エピデルモフィトン属の一種 (*Epidermophyton spp.*)、ユーチパラタ (*Eutypa lata*)、ゲオトリクムカンジズム (*Geotrichum candidum*)、ギベリナセラリス (*Gibellina cerealis*)、グロエオセルコスボラソルギ (*Gloeocercospora sorghi*)、グロエオデスポミゲナ (*Gloeodes pomigena*)、グロエオスポリウムペレナンス (*Gloeosporium perennans*) などの他のものによって引き起こされるものといった汚斑病、斑点病、イモチ病または胴枯れ病および/または腐敗病；グロエオチニアテムレンタ (*Gloeotinia temulenta*)、グリフォスパエリアコルチコラ (*Griphospora a corticola*)、カバチエラリニ (*Kabatiella lini*)、レプトグラフィウムミクロスポルム (*Leptographium microsporum*)、レプトスファエルリニアクラッサスカ (*Leptosphaerulina crassiasca*)、ロフォデルミウムセディチオスム (*Lophodermium seditiosum*)、マルソニナグラミニコラ (*Marssonina graminicola*)、コムギ赤かび病菌 (*Microdochium nivale*)、モニリニアフルクティコーラ (*Monilinia fructicola*)、モノグラフィラアルベセンス (*Monographella albescens*)、モノスポラスカノンバルス (*Monosporascus cannonballus*)、ナエマシクルス属の一種 (*Naemacyclus spp.*)、オフィオストマノボウルミ (*Ophiostomanovo-ulmi*)、パラコシジオイデスブラジリエンシス (*Paracoccidioides brasiliensis*)、ペニシリウムエクソパンスム (*Penicillium expansum*)、ペスタロチアロドデンドリ (*Pestalotia rhododendri*)、ペトリエリジウム属の一種 (*Petriellidium spp.*)、ペジクラ属の一種 (*Pezizula spp.*)、フィアロホラグレガタ (*Phialophora gregata*)、フィラコラポミゲナ (*Phyllachora pomigena*)、フィマトトリクムオムニボラ (*Phymatotrichum omnivora*)、フィサロスポラアブディタ (*Physalospora abdita*)、プレクトスポリウムタバシヌム (*Plectosporium tabacinum*)、ポリシタルムプスツランス (*Polyscytalam pustulans*)、シュードペジザメディカギニス (*Pseudopeziza medicaginis*)、ピレノペジザブラッシカエ (*Pyrenopeziza brassicae*)、ラムリスボラソルギ (*Ramulispora sorghi*)、ラドクリンシュードツガエ (*Rhabdocline pseudotsugae*)、リンコスボリウムセカリス (*Rhynchosporium secalis*)、イネ葉しょう腐敗病菌 (*Sacrocladium oryzae*)、スケドスポリウム属の一種 (*Scedosporium spp.*)、スキゾチリウムポミ (*Schizothyrium pomi*)、スクレロチニアスクレロチオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*)、スクレロチニアミノル (*Sclerotinia minor*)；スクレロチウム属の一種 (*Sclerotium spp.*)、チフライシカリエンシス (*Typhula ishikariensis*)、セイマトスポリウムマリエ (*Seimatosporium mariae*)、レプテウチパクプレッシ (*Lepteutypa cupressi*)、セプトシタルボルム (*Septocytaruborum*)、スファセロマペルセー (*Sphaceloma perseae*)、スポロネマファシデオイデス (*Sporonema phacidoides*)、スティグミナパルミボラ (*Stigminalpalmivora*)、タベシアヤルンデ (*Tap*

10

20

30

40

50

esia yallundae)、タフリナブラタ(*Taphrina bullata*)、チエビオブシスバシコラ(*Thielviopsis basicola*)、トリコセプトリアグルクチゲナ(*Trichoseptoria fructigena*)、ジゴフィアラジャミセンシス(*Zygophiala jamaicensis*)；例えばブルメリアグラミニス(*Blumeria graminis*)、エリシフェポリゴニ(*Erysiphe polygoni*)、ウンシヌラネカトル(*Uncinula necator*)、スファエロテカフリゲナ(*Sphaerotheca fuliginea*)、リンゴうどんこ病菌(*Podosphaera leucotricha*)、ポドスパエラマクラリス(*Podosphaera macularis*)、ゴロビノマイセスシコラセルム(*Golovinomyces cichoracearum*)、レベイルラ
 10
 タウリカ(*Leveillula taurica*)、ミクロスファエラディフッサ(*Microsphaera diffusa*)、オイディオブシスゴッシピイ(*Oidio-
 psis gossypii*)、フィラクチニアグッタタ(*Phyllactinia guttata*)およびオイジウムアラキディス(*Oidium arachidis*)
 などのウドンコカビ目(*Erysiphales*)によって引き起こされるものといった
 ウドンコ病病害；例えばドチオレアラロマチカ(*Dothiorella aromati-
 ca*)、ジプロディアセリアタ(*Diplodia seriata*)、ガイグナルデア
 20
 ビドウェリイ(*Guignardia bidwellii*)、ボトリチスシネレア
 (*Botrytis cinerea*)、ボトリオチニアアリイ(*Botryotinia
 allii*)、ボトリオチニアファビ(*Botryotinia fabae*)、フ
 シコクムアミグダリ(*Fusicoccum amygdali*)、ラシオジプロディア
 テオブロマエ(*Lasiodiplodia theobromae*)、マクロフォーマ
 テイコラ(*Macrophoma theicola*)、マクロフォミナファセオリナ(*Macrophomina
 phaseolina*)、フィロスティクタククルビタセアルム(*Phyllosticta cucurbitacearum*)
 30
 などのボトリオス
 フェリア目(*Botryosphaerales*)によって引き起こされるものとい
 ったかび類；例えばコレトトリカムグロエオスポリオイデス(*Colletotrichum
 gloeosporioides*)、コレトトリカムラゲナリウム(*Colletotrichum
 lagenarium*)、コレトトリカムゴッシピイ(*Colletotrichum
 gossypii*)、グロメララシングラタ(*Glomerella
 cingulata*)およびコレトトリカムグラミニコラ(*Colletotrichum
 graminicola*)などのグロメララレス属(*Glomerellales*)
 40
 によって引き起こされるものといった炭疽病；ならびに、例えばアクレモニウムストリク
 ツム(*Acremonium strictum*)、クラビセプスブルプレア(*Claviceps
 purpurea*)、フザリウムクルモルム(*Fusarium culmorum*)、フザリウムグラミネアルム
 (*Fusarium graminearum*)、フザリウムビルグリホルメ(*Fusarium virguliforme*)、フザリ
 ウムオキシスポルム(*Fusarium oxysporum*)、フザリウムスブグルチ
 ナンス(*Fusarium subglutinans*)、フザリウムオキシスポルム(*Fusarium
 oxysporum f. sp. cubense*)、ゲルラキアニバ
 50
 レ(*Gerlachia nivale*)、ギベレラフジクロイ(*Gibberella fujikuroi*)、ギベレラゼアエ
 (*Gibberella zeae*)、グリオクラジウム属の一種(*Gliocladium spp.*)、ミロテシウムベルカリア
 (*Myrothecium verrucaria*)、ネクトリアラムライエ(*Nectria ramulariae*)、トリコデルマ
 ビリデ(*Trichoderma viride*)、トリコテシウムロセウム(*Trichothecium roseum*)お
 よびベルチシリウムテオブロマエ(*Verticillium theobromae*)
 などの肉座菌目(*Hypocreales*)によって引き起こされるものといった萎凋病
 または胴枯れ病。

例えばウスチラギノイデアビレンス (*Ustilaginoida virens*)、ウスチラゴヌダ (*Ustilago nuda*)、ウスチラゴトリティシ (*Ustilago tritici*)、ウスチラゴゼアエ (*Ustilago zea*) などのクロボキン目 (*Ustilaginales*) によって引き起こされるものといった黒穂病菌を含む担子菌綱 (*Basidiomycete*)、例えばセロテリウムフィチ (*Cerotelium fici*)、クリソミクサルクトスタフィリ (*Chrysomyxa arctostaphyli*)、コレオスポリウムイポモエアエ (*Coleosporium ipomoeae*)、ヘミレイアバスタトリクス (*Hemileia vastatrix*)、プッシニアアラキディス (*Puccinia arachidis*)、プッシニアカカバタ (*Puccinia cacabata*)、プッシニアグラミニス (*Puccinia graminis*)、プッシニアレコンディタ (*Puccinia recondita*)、プッシニアソルギ (*Puccinia sorghi*)、プッシニアホルデイ (*Puccinia hordei*)、プッシニアストリイフォルミス (*Puccinia striiformis f. sp. Hordei*)、プッシニアストリイフォルミス (*Puccinia striiformis f. sp. Secalis*)、プッシニアストルムコリリ (*Puccinia strum coryli*) などのサビキン目 (*Pucciniales*)、または、クロナルチウムリビコラ (*Cronartium ribicola*)、ジumnoスポランギウムジュニペリ - ビジニアネ (*Gymnosporangium juniperi-virginiana*)、メランプソラメデュサエ (*Melampsora medusae*)、ファコブソラパチリジ (*Phakopsora pachyrhizi*)、フラグミジウムムクロナツム (*Phragmidium mucronatum*)、フィソペラアンペロシディス (*Physopella ampeloidis*)、トランスケリアディスコロール (*Tranzschelia discolor*) およびウロマイセスビシエ - ファビエ (*Uromyces viciae-fabae*) などのサビキン目 (*Uredinales*) によって引き起こされるものといったサビ病菌；ならびに、クリプトコックス属の一種 (*Cryptococcus spp.*)、エクソバシジウムベクスアン (*Exobasidium vexans*)、マラスミエルスイノデルマ (*Marasmiellus inoderma*)、マイセナ属の一種 (*Mycena spp.*)、スファセロテカレイリアナ (*Sphaerellotheca reiliana*)、チフライシカリエンシス (*Typhula ishikariensis*)、ウロシスチスアグロピリ (*Urocystis agropyri*)、イテルソニリアペルプレキサン (*Itersonilia perplexans*)、クルチシウムインビスム (*Corticium invisum*)、ラエチサリアフシホルミス (*Laetisaria fuciformis*)、ワイテアシルシナタ (*Waitea circinata*)、イネ紋枯病菌 (*Rhizoctonia solani*)、テンサイ根腐病菌 (*Thanetophorus cucurmeris*)、エンチロマダリアエ (*Entyloma dahliae*)、エンチロメラミクスポラ (*Entylomella microspora*)、ネオボシアモリニアエ (*Neovossia molinae*) およびチレチアカリエス (*Tilletia caries*) によって引き起こされるものなどの他の腐敗病および病害。

【0191】

フィソデルママイディス (*Physoderma maydis*) などのコウマクノウキン目 (*Blastocladiomycetes*)。

【0192】

コアネフォラククリビタルム (*Choanephora cucurbitarum*)；ムコール属の一種 (*Mucor spp.*)；リゾプスアルヒズス (*Rhizopus arrhizus*) などのケカビ綱 (*Mucoromycetes*)。

ならびに、上記に列挙されているものと近縁の他の種および属によって引き起こされる病害。

【0193】

10

20

30

40

50

その殺菌・殺カビ活性に追加して、化合物およびこれらを含む組成物はまた、エルウィニアアミロボラ (*Erwinia amylovora*)、エルウィニアカラトボラ (*Erwinia caratovora*)、キサントモナスカムベストリス (*Xanthomonas campestris*)、シュウドモナスシリंगाエ (*Pseudomonas syringae*)、ストルプトマイセススカビイス (*Striptomyces scabies*) などのバクテリアおよび他の関連する種、ならびに、一定の原生動物に対する活性を有し得る。

【0194】

本発明の範囲内においては、保護されるべき標的作物および/または有用な植物は、典型的には、例えばブラックベリー、ブルーベリー、クランベリー、ラズベリーおよびイチゴといった液果植物；例えばオオムギ、トウモロコシ（コーン）、キビ、カラスムギ、イネ、ライ麦、モロコシ属 (*sorghum*) ライコムギおよびコムギといった穀類；例えば綿、亜麻、アサ、ジュートおよびサイザルといった繊維植物；例えば糖質および飼料ビート、コーヒー、ホップ、マスタード、アブラナ（カノーラ）、ケシ、サトウキビ、ヒマワリ、チャおよびタバコといった農作物；例えばリンゴ、アンズ、アボカド、バナナ、サクランボ、柑橘類、ネクタリン、モモ、セイヨウナシおよびセイヨウスモモといった果樹；例えばバミューダグラス、イチゴツナギ、ベントグラス、センチピードグラス、ウシノケグサ、ライグラス、アメリカシバおよびノシバといった草；バジル、ルリジサ、チャイブ、コリアンダー、ラベンダー、ラベージ、ミント、オレガノ、パセリ、ローズマリー、セージおよびタイムなどのハーブ；例えばインゲンマメ、レンズマメ、エンドウマメおよびダイズ、インゲンマメといったマメ科植物；例えばアーモンド、カシュー、落花生、ヘーゼルナッツ、ピーナッツ、ペカン、ピスタチオおよびクルミといった堅果；例えばアブラヤシといったヤシ；例えば花、低木および高木といった観賞用植物；例えばカカオ、ココナツ、オリーブおよびゴムといった他の高木；例えばアスパラガス、ナス、ブロッコリ、キャベツ、ニンジン、キュウリ、ニンニク、レタス、ペポカボチャ、メロン、オクラ、タマネギ、コショウ、ジャガイモ、カボチャ、ダイオウ、ハウレンソウおよびトマトといった野菜；ならびに、例えばブドウといったつる植物などの多年生および1年生作物を含む。

【0195】

本発明に係る有用な植物および/または標的作物は、例えば、昆虫抵抗性（例えば Bt および VIP 品種）ならびに病害抵抗性、除草剤耐性（商品名 Roundup Ready（登録商標）および Liberty Link（登録商標）で市販されている例えばグリホサート - およびグルホシネート - 耐性トウモロコシ品種）および線虫抵抗性品種などの従来品種、ならびに、遺伝子的に強化または遺伝子操作された品種を含む。一例として、好適に遺伝子的に強化または遺伝子操作された品種は、Stoneville 5599 BR 綿および Stoneville 4892 BR 綿品種を含む。

【0196】

「有用な植物」および/または「標的作物」という用語は、従来交配または遺伝子操作方法によって、プロモキシニルのような除草剤、または、ある分類の除草剤（例えば、HPPD 抑制剤、ALS 抑制剤、例えばプリミスルフロン、プロスルフロンおよびトリフロキシスルフロン、EPSPS（5-エノール-ピロピル-シキメート-3-リン酸塩-シンターゼ）抑制剤、GS（グルタミンシンターゼ）抑制剤または PPO（プロトポルフィリノーゲン-オキシダーゼ）抑制剤など）に対する耐性がもたらされた有用な植物をも含むと理解されるべきである。従来交配方法（突然変異誘発）によって、例えばイマザモックスといったイミダゾリノンに対する耐性がもたらされた作物の一例は、Clearfield（登録商標）夏ナタネ（カノーラ）である。遺伝子操作方法によって除草剤またはあるクラスの除草剤に対する耐性がもたらされた作物の例としては、商品名 Roundup Ready（登録商標）、Herculex I（登録商標）および Liberty Link（登録商標）で市販されているグリホサート - およびグルホシネート - 耐性トウモロコシ品種が挙げられる。

10

20

30

40

50

【0197】

「有用な植物」および/または「標的作物」という用語は、自然発生的なもの、または、有害な昆虫に対する抵抗性が与えられたものを含むと理解されるべきである。これは、トキシン - 産生バクテリア由来として公知であるものなどの1種以上の選択的に作用するトキシンの合成能を例えば有するよう、組換えDNA技術を用いることで形質転換された植物を含む。発現されることが可能であるトキシンの例としては、 δ -エンドトキシン、栄養型殺虫性タンパク質 (Vip)、線虫共生バクテリアの殺虫性タンパク質、ならびに、サソリ、蛛形類、大型のハチ (wasp) および真菌によって産生されるトキシンが挙げられる。バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) トキシンを発現するよう変性された作物の一例は、Bt トウモロコシ Knock Out (登録商標) (Syngenta Seeds) である。殺虫性耐性をコードする2種以上の遺伝子を含み、それ故、2種以上のトキシンを発現する作物の一例は、Vip Coat (登録商標) (Syngenta Seeds) である。作物またはその種子材料もまた、複数種の有害生物に対して耐性であることが可能である (いわゆる、遺伝子修飾により形成される場合の重畳的なトランスジェニックイベント)。例えば、植物は、例えば *Herculex I* (登録商標) (Dow AgroSciences, Pioneer Hi-Bred International) のように除草剤耐性であると同時に、殺虫性タンパク質の発現能を有していることが可能である。

10

【0198】

用語「有用な植物」および/または「標的作物」は、例えば、いわゆる「感染特異的タンパク質」(PRP、例えば欧州特許出願公開第0 392 225号明細書を参照のこと) などの選択的な作用を有する抗病原性物質を合成することが可能であるよう組換えDNA技術を用いて形質転換された有用な植物をも含むと理解されるべきである。このような抗病原性物質およびこのような抗病原性物質を合成可能である形質転換植物の例は、例えば、欧州特許出願公開第0 392 225号明細書、国際公開第95/33818号および欧州特許出願公開第0 353 191号明細書から公知である。このような形質転換植物を製造する方法は一般に当業者に公知であると共に、例えば、上記の公報に記載されている。

20

【0199】

形質転換植物によって発現されることが可能であるトキシンとしては、例えば、セレウス菌 (*Bacillus cereus*) またはバチルスポピリアエ (*Bacillus popilliae*) 由来の殺虫性タンパク質; または、例えば Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1 もしくは Cry9C といった δ -エンドトキシンなどのバチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 由来の殺虫性タンパク質、または、例えば Vip1、Vip2、Vip3 もしくは Vip3A といった栄養型殺虫性タンパク質 (Vip); または、フォトラブダスルミネセンス (*Photobacterium luminescens*)、ゼノラブダスネマトフィルス (*Xenorhabdus nematophilus*) などの、例えばフォトラブダス属の一種 (*Photobacterium* spp.) もしくはゼノラブダス属の一種 (*Xenorhabdus* spp.) といった線虫共生バクテリアの殺虫性タンパク質; サソリトキシン、クモトキシン、大型のハチ (wasp) トキシンおよび他の昆虫特異的神経トキシンなどの動物によって生成されるトキシン; ストレプトミセス (*Streptomyces*) トキシンなどの真菌によって生成されるトキシン、エンドウマメレクチン、オオムギレクチンまたはマツユキソウレクチンなどの植物レクチン; アグルチニン; トリプシン抑制剤、セリタンパク分解酵素抑制剤、パタチン、シスタチン、パパイン抑制剤などのプロテイナーゼ抑制剤; リシン、トウモロコシ-RIP、アプリン、ルフィン、サポリンまたはブリオジンなどのリボソーム - 不活性化タンパク質 (RIP); 3-ヒドロキシステロイドキシダーゼ、エクジステロイド-UDP-グリコシル-トランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン抑制剤、HMG-CoA-レダクターゼなどのステロイド代謝酵素、ナトリウムまたは

30

40

50

カルシウム遮断剤などのイオンチャネル遮断剤、幼虫ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシクターゼ、ピベンジルシクターゼ、キチナーゼおよびグルカナナーゼが挙げられる。

【0200】

さらに、本発明の文脈においては、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1もしくはCry9Cといった - エンドトキシン、または、例えばVip1、Vip2、Vip3もしくはVip3Aといった栄養型殺虫性タンパク質 (Vip) とは、特にハイブリッドトキシン、切断型トキシンおよび修飾トキシンでもあることが理解されるべきである。ハイブリッドトキシンは、これらのタンパク質の異なるドメインの新たな組み合わせによって組換えで生成される (例えば、国際公開第02/15701号を参照のこと)。例えば切断型Cry1Abといった切断型トキシンが公知である。修飾トキシンの場合、天然トキシンの1種以上のアミノ酸が置換される。このようなアミノ酸置換において、好ましくは自然に存在しないタンパク分解酵素認識配列がトキシンに挿入され、例えば、Cry3A055の場合には、カテプシン - G - 認識配列がCry3Aトキシンに挿入される (国際公開第03/018810号を参照のこと)。

10

【0201】

このようなトキシン、または、このようなトキシンを合成可能な形質転換植物のさらなる例が、例えば、欧州特許出願公開第A - 0 374 753号明細書、国際公開第93/07278号、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第A - 0 427 529号明細書、欧州特許出願公開第A - 451 878号明細書および国際公開第03/052073号に開示されている。

20

【0202】

このような形質転換植物の調製プロセスは一般に当業者に公知であり、例えば、上記の刊行物において記載されている。CryI - タイプデオキシリボ核酸およびその調製は、例えば、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第A - 0 367 474号明細書、欧州特許出願公開第A - 0 401 979号明細書および国際公開第90/13651号から公知である。

【0203】

形質転換植物に含有されるトキシンは、有害な昆虫に対する耐性を植物に付与する。このような昆虫は昆虫の分類群のいずれかのものであることが可能であるが、特に、甲虫 (鞘翅目)、双翅昆虫 (双翅目) および蝶 (鱗翅目) に通例見出される。

30

【0204】

殺虫耐性をコードし、1種以上のトキシンを発現する1種以上の遺伝子を含む形質転換植物は公知であり、そのいくつかは市販されている。このような植物の例は: YieldGard (登録商標) (Cry1Abトキシンを発現するトウモロコシ品種); YieldGard Rootworm (登録商標) (Cry3Bb1トキシンを発現するトウモロコシ品種); YieldGard Plus (登録商標) (Cry1AbおよびCry3Bb1トキシンを発現するトウモロコシ品種); Starlink (登録商標) (Cry9Cトキシンを発現するトウモロコシ品種); Herculex I (登録商標) (Cry1Fa2トキシンおよび酵素ホスフィトリシンN - アセチルトランスフェラーゼ (PAT) を発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成されているトウモロコシ品種); NuCOTN 33B (登録商標) (Cry1Actトキシンを発現する綿品種); Bollgard I (登録商標) (Cry1Actトキシンを発現する綿品種); Bollgard II (登録商標) (Cry1AcおよびCry2Abトキシンを発現する綿品種); VipCot (登録商標) (Vip3AおよびCry1Abトキシンを発現する綿品種); NewLeaf (登録商標) (Cry3Aトキシンを発現するジャガイモ品種); NatureGard (登録商標)、Agrisure (登録商標) GT Advantage (GA21グリホサート - 耐性形質)、Agrisure (登録商標) CB Advantage (Bt11コーン穿孔性害虫 (CB) 形質) および

40

50

Protecta (登録商標)である。

【0205】

このような形質転換作物のさらなる例は以下のとおりである：

1. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France 製 Bt11 トウモロコシ、登録番号 C/FR/96/05/10。切断型 Cry1Ab トキシンのトランスジェニック発現により、アワノメイガ (ヨーロッパアワノメイガ (*Ostrinia nubilalis*)) およびセサミアノナグリオイデス (*Sesamia nonagrioides*)) に対する耐性が付与された遺伝子操作されたトウモロコシ (*Zea mays*)。Bt11 トウモロコシはまた、酵素 PAT をトランスジェニック発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成している。

10

【0206】

2. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France 製 Bt176 トウモロコシ、登録番号 C/FR/96/05/10。Cry1Ab トキシンのトランスジェニック発現によって、アワノメイガ (ヨーロッパアワノメイガ (*Ostrinia nubilalis*)) およびセサミアノナグリオイデス (*Sesamia nonagrioides*)) に対する耐性が付与された遺伝子操作されたトウモロコシ (*Zea mays*)。Bt176 トウモロコシはまた、酵素 PAT をトランスジェニック発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成している。

20

【0207】

3. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France 製 MIR604 トウモロコシ、登録番号 C/FR/96/05/10。修飾 Cry3A トキシンのトランスジェニック発現により昆虫耐性が付与されたトウモロコシ。このトキシンは、カテプシン-G-タンパク分解酵素認識配列の挿入により修飾された Cry3A055 である。このような形質転換トウモロコシ植物の調製は、国際公開第 03/018810 号に記載されている。

【0208】

4. Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium 製 MON863 トウモロコシ、登録番号 C/DE/02/9。MON863 は、Cry3Bb1 トキシンを発現し、一定の鞘翅目昆虫に対する耐性を有する。

30

【0209】

5. Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium 製 IPC531 綿、登録番号 C/ES/96/02。

【0210】

6. Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium 製 1507 トウモロコシ、登録番号 C/NL/00/10。一定の鱗翅目昆虫に対する耐性を達成するタンパク質 Cry1F の発現、および、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成するための PAT タンパク質の発現のために遺伝子操作されたトウモロコシ。

40

【0211】

7. Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium 製 NK603 x MON810 トウモロコシ、登録番号 C/GB/02/M3/03。遺伝子操作品種 NK603 および MON810 を交配させることによる従来交配型ハイブリッドトウモロコシ品種からなる。NK603 x MON810 トウモロコシは、アグロバクテリウム属の一種 (*Agrobacterium* sp.) の菌株 CP4 から得られるタンパク質 CP4

50

EPSPSをトランスジェニック発現し、これにより、除草剤Roundup(登録商標)(グリホサートを含む)に対する耐性が付与され、また、バチルスチューリンゲンシス(*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*)から得られるCry1Abトキシンをトランスジェニック発現し、これにより、アワノメイガを含む一定の鱗翅目に対する耐性がもたらされる。

【0212】

本明細書において用いられるところ、「生息地」という用語は、植物が成長している圃場、または、栽培されている植物の種子が播種された圃場、または、種子が土壤に蒔かれることとなる圃場を意味する。これは、土壤、種子および実生、ならびに、確立した植生を含む。

10

【0213】

「植物」という用語は、種子、実生、苗、根、塊茎、茎、柄、群葉および果実を含む植物のすべての物理的な部分を指す。

【0214】

「植物繁殖体」という用語は、その増殖に用いられることが可能である種子などの植物の生殖部、および、挿し木もしくは例えばジャガイモといった塊茎などの栄養体を表すと理解される。例えば種子(厳密な意味で)、根、果実、塊茎、鱗茎、根茎および植物の部分が挙げられ得る。発芽後もしくは土壤から出芽した後に移植されることとなる発芽した植物および若芽もまた挙げられる。これらの若芽は、移植前に浸漬による完全または部分的な処置によって保護されてもよい。好ましくは、「植物繁殖体」は種子を表すと理解される。

20

【0215】

慣用名を用いて本明細書において言及される有害生物防除剤は、例えば、“The Pesticide Manual”, 15th Ed., British Crop Protection Council 2009から公知である。

【0216】

式(I)の化合物は、そのままの形態で、または、好ましくは、配合技術分野において簡便に採用される補助剤と一緒に用いられ得る。この目的のためにこれらは、公知の様式で、乳化性濃縮物、コーティング用ペースト、直接噴射可能もしくは希釈可能な溶液または懸濁液、希釈エマルジョン、水和剤、可溶性粉末、粉剤、粒質物、および、例えば高分子物質中のカプセルに簡便に配合され得る。組成物のタイプと同様に、吹付け、霧吹き、散粉、散布、コーティングまたは掛け流しなどの適用方法が、意図される目的およびその時点での状況に応じて選択される。組成物はまた、安定化剤、消泡剤、粘度調節剤、バインダまたは粘着剤、ならびに、肥料、微量元素の供給源、または、特別な効果を得るための他の配合物などのさらなる補助剤を含有していてもよい。

30

【0217】

例えば農業に用いられる好適なキャリアおよび補助剤は、固体または液体であることが可能であり、配合技術において有用な物質であり、例えば天然もしくは再生ミネラル物質、溶剤、分散剤、湿潤剤、粘着剤、増粘剤、バインダまたは肥料である。このようなキャリアは、例えば国際公開第97/33890号に記載されている。

40

【0218】

懸濁液濃縮物は、活性な化合物の微細な固体粒子が懸濁した水性配合物である。このような配合物は沈降防止剤および分散剤を含むと共に、活性を高めるために湿潤剤、ならびに、消泡剤および結晶成長抑制剤をさらに含み得る。使用においては、これらの濃縮物は水中で希釈され、通常は処理されるべき領域にスプレーで適用される。活性成分の量は濃縮物の0.5%~95%の範囲内であり得る。

【0219】

水和剤は、水または他の液体キャリア中に容易に分散する微細粒子の形態である。これらの粒子は、固体マトリックスに保持された活性成分を含有する。典型的な固体マトリックスとしては、フラー土、カオリンクレイ、シリカおよび他の易湿性の有機もしくは無

50

機固形分が挙げられる。水和剤は通常、5%～95%の活性成分と少量の湿潤剤、分散剤または乳化剤とを含有する。

【0220】

乳化性濃縮物は水または他の液体中に分散性である均質な液体組成物であって、活性な化合物と液体もしくは固体乳化剤とからのみ構成されていてもよく、または、キシレン、高沸点芳香族ナフサ、イソホロンおよび他の揮発性有機溶剤などの液体キャリアを含有していてもよい。使用においては、これらの濃縮物は水または他の液体中に分散され、通常は処理されるべき領域にスプレーで適用される。活性成分の量は濃縮物の0.5%～95%の範囲内であり得る。

【0221】

粒状配合物は押出物および比較的粗大な粒子の両方を含み、通常は、処理が必要とされる領域に希釈されることなく適用される。粒状配合物に係る典型的なキャリアとしては、活性な化合物を吸収するか活性な化合物でコーティング可能である、砂、フーラー土、アタパルジャイトクレイ、ベントナイトクレイ、モンモリロナイトクレイ、パーミキュライト、パーライト、炭酸カルシウム、れんが、軽石、葉ろう石、カオリン、ドロマイト、焼き石膏、木粉、粉碎したトウモロコシ穂軸、粉碎したピーナッツの外殻、砂糖、塩化ナトリウム、硫酸ナトリウム、ナトリウムケイ酸、ホウ酸ナトリウム、マグネシア、雲母、酸化鉄、酸化亜鉛、酸化チタン、酸化アンチモン、氷晶石、石膏、珪藻土、硫酸カルシウムおよび他の有機もしくは無機材料が挙げられる。粒状配合物は通常5%～25%の活性成分を含有し、これは、高沸点芳香族ナフサ、ケロシンおよび他の石油留分などの表面活性剤、もしくは、植物油；ならびに/または、デキストリン、膠もしくは合成樹脂などの展着剤を含んでいてもよい。

【0222】

粉剤は、活性成分と、分散剤およびキャリアとして作用するタルク、クレイ、粉末ならびに他の有機および無機固形分などの微細固形分との易流動性の混和物である。

【0223】

マイクロカプセルは、典型的には、内包された材料を制御された速度で周囲に放出させることが可能である不活性の多孔性シェルに内包された活性成分の小滴または顆粒である。カプセル化された小滴は、直径が典型的には1～50ミクロンである。内包された液体は典型的には、カプセルの重量の50～95%を構成し、活性な化合物に追加して溶剤を含んでいてもよい。カプセル化された顆粒は一般に、顆粒の孔部開口をシールして、液体形態の活性種を顆粒の孔部内に保持する多孔性メンブランを有する多孔性顆粒である。顆粒は典型的には、直径が1ミリメートル～1センチメートル、好ましくは1～2ミリメートルの範囲内である。顆粒は、押し成形、凝塊もしくはプリルによって形成されるか、または、天然のものである。このような材料の例は、パーミキュライト、焼成クレイ、カオリン、アタパルジャイトクレイ、おがくずおよび粒状炭素である。シェルまたはメンブラン材料は、天然および合成ゴム、セルロース系材料、スチレン-ブタジエンコポリマー、ポリアクリロニトリル、ポリアクリレート、ポリエステル、ポリアミド、ポリウレア、ポリウレタンおよびデンブンザンデートを含む。

【0224】

農芸化学用途に係る他の有用な配合物は、アセトン、アルキル化ナフタレン、キシレンおよび他の有機溶剤などの、所望の濃度での完全な溶解が達成される溶剤中における活性成分の単なる溶液を含む。低沸点分散剤溶剤キャリアの蒸発に伴って活性成分が微細に分離された形態に散布される加圧散布機もまた用いられ得る。

【0225】

上記の配合物タイプの本発明の組成物の配合に有用である好適な農業用補助剤およびキャリアは、当業者に周知である。

【0226】

利用可能である液体キャリアとしては、例えば、水、トルエン、キシレン、石油ナフサ油、作物油、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン、無水酢酸、アセトニト

10

20

30

40

50

リル、アセトフェノン、酢酸アミル、2 - ブタノン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、シクロヘキサノール、アルキル酢酸塩、ジアセトンアルコール、1, 2 - ジクロロプロパン、ジエタノールアミン、p - ジエチルベンゼン、ジエチレングリコール、ジエチレングリコールアピエテート、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N, N - ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1, 4 - ジオキサン、ジプロピレングリコール、ジプロピレングリコールメチルエーテル、ジプロピレングリコールジベンゾエート、ジプロキシトール、アルキルピロリジノン、酢酸エチル、2 - エチルヘキサノール、エチレンカーボネート、1, 1, 1 - トリクロロエタン、2 - ヘプタノン、ピネン、d - リモネン、エチレングリコール、エチレングリコールブチルエーテル、エチレングリコールメチルエーテル、
 - ブチロラクトン、グリセロール、グリセロール二酢酸、グリセロール酢酸、グリセロールトリアセテート、ヘキサデカン、ヘキシレングリコール、酢酸イソアミル、酢酸イソボルニル、イソオクタン、イソホロン、イソプロピルベンゼン、ミリスチン酸イソプロピル、乳酸、ラウリルアミン、メシチルオキシド、メトキシ - プロパノール、メチルイソアミルケトン、メチルイソブチルケトン、ラウリン酸メチル、オクタン酸メチル、オレイン酸メチル、塩化メチレン、m - キシレン、n - ヘキサン、n - オクチルアミン、クタデカン酸、オクチルアミンアセテート、オレイン酸、オレイルアミン、o - キシレン、フェノール、ポリエチレングリコール (P E G 4 0 0)、プロピオン酸、プロピレングリコール、プロピレングリコールモノメチルエーテル、p - キシレン、トルエン、リン酸トリエチル、トリエチレングリコール、キシレンスルホン酸、パラフィン、鉱油、トリクロロエチレン、パークロロエチレン、酢酸エチル、酢酸アミル、酢酸ブチル、メタノール、エタノール、イソプロパノール、および、アミルアルコール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ヘキサノール、オクタノール等などの高分子量アルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、グリセリンおよびN - メチル - 2 - ピロリジノンが挙げられる。濃縮物の希釈には、水が一般的に選択されるキャリアである。

【 0 2 2 7 】

好適な固体キャリアとしては、例えば、タルク、二酸化チタン、葉ろう石クレイ、シリカ、アタパルジャイトクレイ、キースラガー、チョーク、珪藻土、石灰、炭酸カルシウム、ベントナイトクレイ、フーラー土、綿実の外殻、小麦粉、ダイズ粉、軽石、木粉、クルミの外殻粉およびリグニンが挙げられる。

【 0 2 2 8 】

幅広い範囲の表面活性剤が、特に適用前にキャリアで希釈されるよう設計されたものといった、前記液体および固体組成物の両方において有利に利用される。これらの表面活性剤は通常、使用される際、0.1% ~ 15重量%の配合物を含む。これらはアニオン性、カチオン性、ノニオン性または高分子特性であることが可能であり、乳化剤、湿潤剤、懸濁剤として、または、他の目的のために利用されることが可能である。典型的な表面活性剤としては、ラウリル硫酸ジエタノールアンモニウムなどのアルキル硫酸塩；ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなどのアルキルアリアルスルホネート塩；ノニルフェノール - C . s u b . 1 8 エトキシレートなどのアルキルフェノール - アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコール - C . s u b . 1 6 エトキシレートなどのアルコール - アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウムなどの石鹸；ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウムなどのアルキルナフタレンスルホン酸塩；ジ (2 - エチルヘキシル) スルホコハク酸ナトリウムなどのスルホコハク酸塩のジアルキルエステル；ソルビトールオレエートなどのソルビトールエステル；ラウリルトリメチル塩化アンモニウムなどの第4級アミン；ステアリン酸ポリエチレングリコールなどの脂肪酸のポリエチレングリコールエステル；エチレンオキシドおよびプロピレンオキシドのブロックコポリマー；ならびに、モノおよびジアルキルリン酸エステルの塩が挙げられる。

【 0 2 2 9 】

農業用組成物において通例利用される他の補助剤としては、結晶化抑制剤、粘度変性剤、懸濁剤、噴霧粒調節剤、顔料、酸化防止剤、発泡剤、消泡剤、遮光剤、相溶化剤、消泡

10

20

30

40

50

剤、金属イオン封鎖剤、中和剤および緩衝剤、腐食抑制剤、染料、臭気剤、展着剤、浸透助剤、微量元素、緩和剤、潤滑剤および固着剤が挙げられる。

【0230】

さらに加えて、他の殺生性活性成分または組成物を、本発明の組成物と組み合わせ、本発明の方法において用い、および、本発明の組成物と同時にまたは順次に適用してもよい。同時に適用する場合、これらのさらなる活性成分は、本発明の組成物と一緒に配合されても、または、例えば、噴霧タンク中で一緒に混合されてもよい。これらのさらなる殺生性活性成分は、殺菌・殺力ピ剤、除草剤、殺虫剤、殺菌剤 (bactericide)、殺ダニ剤、殺線虫剤および/または植物成長調節剤であり得る。

【0231】

加えて、本発明の組成物はまた、1種以上の全身獲得抵抗性誘導物質(「SAR」誘導物質)と一緒に適用され得る。SAR誘導物質は公知であって、例えば米国特許第6,919,298号明細書に記載されており、例えば、サリチル酸塩および市販されているSAR誘導物質であるアシベンゾラル-S-メチルが挙げられる。

【0232】

式(I)の化合物は通常組成物の形態で用いられ、処理されるべき作物領域または植物に、さらなる化合物と同時に、または、順次に適用されることが可能である。これらのさらなる化合物は、例えば肥料もしくは微量元素供与物、または、植物の成長に影響を及ぼす他の調製物であることが可能である。これらはまた、選択的な除草剤もしくは非選択的な除草剤、ならびに、殺虫剤、殺菌・殺力ピ剤、殺菌剤、殺線虫剤、軟体動物駆除剤であることが可能であり、または、これらの調製物の数種の混合物であって、所望の場合には配合物の分野において慣例的に利用されるさらなるキャリア、界面活性剤もしくは適用促進補助剤を伴う混合物であることが可能である。

【0233】

式(I)の化合物は、活性成分として少なくとも1種の式(I)の化合物を含む、植物病原性微生物に対する防除もしくは保護のための(殺菌・殺力ピ)組成物の形態で用いられ得、または、遊離形態もしくは農芸化学的に使用可能な塩形態の上記に定義されている少なくとも1種の好ましい個別の化合物と、上記の補助剤の少なくとも1種との形態で用いられ得る。

【0234】

作物の管理においては通常、栽培者は、本発明の化合物に追加して、1種または複数種の他の農薬を用いるであろう。農薬の例としては、殺ダニ剤、殺菌剤、殺菌・殺力ピ剤、除草剤、殺虫剤、殺線虫剤などの有害生物防除剤、ならびに、植物栄養分および植物肥料が挙げられる。

【0235】

従って、本発明は、本発明に係る式(I)の化合物を、1種または複数種の有害生物防除剤、植物栄養分または植物肥料と一緒に含む組成物を提供する。この組み合わせはまた、例えば従来からの交配または遺伝子修飾といったいずれかの手段を用いて植物に組み込まれた特定の植物形質を包含し得る。このような組成物はまた、上記のとおり1種または複数種の不活性キャリアを含有し得る。

【0236】

本発明はまた、本発明に係る式(I)の化合物を、1種または複数種の有害生物防除剤、植物栄養分または植物肥料と一緒に含む組成物の使用をも提供する。この組み合わせはまた、例えば従来からの交配または遺伝子修飾といったいずれかの手段を用いて植物に組み込まれた特定の植物形質を包含し得る。

【0237】

植物栄養分または植物肥料の好適な例は硫酸カルシウム(CaSO_4)、硝酸カルシウム($\text{Ca}(\text{NO}_3)_2 \cdot 4\text{H}_2\text{O}$)、炭酸カルシウム(CaCO_3)、硝酸カリウム(KNO_3)、硫酸マグネシウム(MgSO_4)、カリウム水素リン酸塩(KH_2PO_4)、硫酸マンガン(MnSO_4)、硫酸銅(CuSO_4)、硫酸亜鉛(ZnSO_4)、塩化ニッケル(N

10

20

30

40

50

iCl_2)、硫酸コバルト($CoSO_4$)、水酸化カリウム(KOH)、塩化ナトリウム($NaCl$)、硼酸(H_3BO_3)、および、その金属塩(Na_2MoO_4)である。栄養分は、各々、5%~50重量%、好ましくは10%~25重量%、または、15%~20重量%の量で存在し得る。好ましい追加の栄養分は、尿素($(NH_2)_2CO$)、メラミン($C_3H_6N_6$)、酸化カリウム(K_2O)および無機硝酸塩である。最も好ましい追加の植物栄養分は酸化カリウムである。好ましい追加の栄養分が尿素である場合、これは、一般に1%~20重量%、好ましくは2%~10重量%、または、3%~7重量%の量で存在する。

【0238】

有害生物防除剤の好適な例は、アシクロアミノ酸殺菌・殺カビ剤、脂肪族窒素殺菌・殺カビ剤、アミド殺菌・殺カビ剤、アニリド殺菌・殺カビ剤、抗生物質系殺菌・殺カビ剤、芳香族殺菌・殺カビ剤、ヒ素殺菌・殺カビ剤、アリールフェニルケトン殺菌・殺カビ剤、ベンズアミド殺菌・殺カビ剤、ベンズアニリド殺菌・殺カビ剤、ベンズイミダゾール殺菌・殺カビ剤、ベンゾチアゾール殺菌・殺カビ剤、植物学的殺菌・殺カビ剤、架橋ジフェニル殺菌・殺カビ剤、カルバメート殺菌・殺カビ剤、カルバニレート殺菌・殺カビ剤、コナゾール殺菌・殺カビ剤、銅殺菌・殺カビ剤、ジカルボキシイミド殺菌・殺カビ剤、ジニトロフェノール殺菌・殺カビ剤、ジチオカルバメート殺菌・殺カビ剤、ジチオラン殺菌・殺カビ剤、フラミド殺菌・殺カビ剤、フラニリド殺菌・殺カビ剤、ヒドラジド殺菌・殺カビ剤、イミダゾール殺菌・殺カビ剤、水銀殺菌・殺カビ剤、モルホリン殺菌・殺カビ剤、有機リン殺菌・殺カビ剤、有機スズ殺菌・殺カビ剤、オキサチン殺菌・殺カビ剤、オキサゾール殺菌・殺カビ剤、フェニルスルファミド殺菌・殺カビ剤、ポリスルフィド殺菌・殺カビ剤、ピラゾール殺菌・殺カビ剤、ピリジン殺菌・殺カビ剤、ピリミジン殺菌・殺カビ剤、ピロール殺菌・殺カビ剤、第4級アンモニウム殺菌・殺カビ剤、キノリン殺菌・殺カビ剤、キノン殺菌・殺カビ剤、キノキサリン殺菌・殺カビ剤、ストロビルリン殺菌・殺カビ剤、スルホンアニリド殺菌・殺カビ剤、チアジアゾール殺菌・殺カビ剤、チアゾール殺菌・殺カビ剤、チアゾリジン殺菌・殺カビ剤、チオカルバメート殺菌・殺カビ剤、チオフェン殺菌・殺カビ剤、トリアジン殺菌・殺カビ剤、トリアゾール殺菌・殺カビ剤、トリアゾロピリミジン殺菌・殺カビ剤、尿素殺菌・殺カビ剤、パリンアミド殺菌・殺カビ剤、亜鉛殺菌・殺カビ剤、ベンゾイル尿素、カルバメート、クロロニコチニル、ジアシルヒドラジン、ジアミド、フィプロル、マクロライド、ニトロイミン、ニトロメチレン、有機塩素、有機リン酸塩、有機ケイ素、有機スズ、フェニルピラゾール、リン酸エステル、ピレスロイド、スピノシン、テトラミン酸誘導体、テトロン酸誘導体、抗生物質系殺線虫剤、アベルメクチン殺線虫剤、植物学的殺線虫剤、カルバメート殺線虫剤、オキシムカルバメート殺線虫剤、有機リン殺線虫剤、線虫捕食菌またはバクテリア、アミド除草剤、アニリド除草剤、ヒ素除草剤、アリールアラニン除草剤、アリールオキシフェノキシプロピオン酸除草剤、ベンゾフラニル除草剤、安息香酸除草剤、ベンゾチアゾール除草剤、ベンゾイルシクロヘキサジオン除草剤、カルバメート除草剤、カルバニレート除草剤、クロロアセタニリド除草剤、クロロトリアジン除草剤、シクロヘキセンオキシム除草剤、シクロプロピルイソキサゾール除草剤、ジカルボキシイミド除草剤、ジニトロアニリン除草剤、ジニトロフェノール除草剤、ジフェニルエーテル除草剤、ジチオカルバメート除草剤、フルオロアルキルトリアジン除草剤、ハロゲン化脂肪族除草剤、イミダゾリノン除草剤、無機除草剤、メトキシトリアジン除草剤、メチルチオトリアジン除草剤、ニトリル除草剤、ニトロフェニルエーテル除草剤、有機リン除草剤、オキサジアゾロン除草剤、オキサゾール除草剤、フェノキシ除草剤、フェノキシ酢酸除草剤、フェノキシ酪酸除草剤、フェノキシプロピオン酸除草剤、フェニレンジアミン除草剤、フェニル尿素除草剤、フタル酸除草剤、ピコリン酸除草剤、ピラゾール除草剤、ピリダジン除草剤、ピリダジノン除草剤、ピリジン除草剤、ピリミジンジアミン除草剤、ピリミジニルオキシベンジルアミン除草剤、ピリミジニルスルホニル尿素除草剤、第4級アンモニウム除草剤、キノリンカルボン酸除草剤、スルホンアミド除草剤、スルホンアニリド除草剤、スルホニル尿素除草剤、チアジアゾリル尿素除草剤、チオアミド除草剤、チオカルバメート除草剤、チオ炭酸塩除草剤、チオ

10

20

30

40

50

尿素除草剤、トリアジン除草剤、トリアジノン除草剤、トリアジニルスルホニル尿素除草剤、トリアゾール除草剤、トリアゾロン除草剤、トリアゾロピリミジン除草剤、ウラシル除草剤、尿素除草剤、微生物、植物抽出物、フェロモン、微生物製剤および他の生物学的製剤である。

【0239】

本発明のさらなる態様は、作物植物、例えば種子といったその繁殖体、例えば収穫された食品作物といった収穫された作物などの例えば有用な植物といった植物、または、昆虫、もしくは、特に真菌性生物といった植物病原性もしくはヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物もしくは生物による非生体材料に係る外寄生を防除もしくは予防する方法に関し、この方法は、式(I)の化合物もしくは上記に定義されている好ましい個別の化合物を、活性成分として植物、植物の一部もしくはその生息地、その繁殖体、または、非生体材料のいずれかの部分に適用するステップを含む。

10

【0240】

防除もしくは予防とは、昆虫による、または、特に真菌性生物といった植物病原性もしくはヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物もしくは生物による外寄生を、向上が実証されるレベルまで低減させることを意味する。

【0241】

特に真菌性生物といった植物病原性微生物または昆虫による作物植物の外寄生を防除もしくは予防する好ましい方法であって、式(I)の化合物または前記化合物の少なくとも1種を含有する農芸化学組成物の適用を含む方法は、葉面処理である。適用頻度および適用量は、対応する病原体または昆虫による外寄生のリスクに応じることとなる。しかしながら、式(I)の化合物はまた、植物の生息地に液体配合物を灌注することにより、または、例えば粒状形態(土壌施用)の固体形態で化合物を土壌に適用することにより、土壌(浸透移行作用)を介して根から植物に浸透させることが可能である。水稻作物の場合、このような粒質物を湛水した水田に適用することが可能である。式(I)の化合物はまた、種子または塊茎を殺菌・殺カビ剤の液体配合物に含浸させることにより、または、これらを固体配合物でコーティングすることにより、種子に適用(コーティング)され得る。

20

【0242】

例えば、式(I)の化合物と、所望の場合に、式(I)の化合物をカプセル化する固体または液体補助剤またはモノマーとを含有する組成物といった配合物は、公知の様式で、典型的には、化合物を例えば溶剤、固体キャリアおよび任意選択により表面活性化合物(界面活性剤)といった増量剤と一緒に均質に混合し、および/または、粉碎することにより調製され得る。

30

【0243】

流行している状況における意図される目的、および、上述の種類の有害生物を防除するための組成物の使用に適合するよう選択されるべきである、吹付け、噴霧、散粉、はけ塗り、粉衣、拡散または流しかけなどの上述の種類の有害生物の防除方法である組成物の適用方法が本発明の他の主題である。典型的な濃度割合は、0.1~1000 ppm、好ましくは0.1~500 ppmの活性成分である。1ヘクタール当たりの適用量は、好ましくは1g~2000gの活性成分/ヘクタール、より好ましくは10~1000g/ha、最も好ましくは10~600g/haである。種子灌注剤として用いられる場合、簡便な投与量は、1kgの種子に対して10mg~1gの活性物質である。

40

【0244】

本発明の組み合わせが種子の処理に用いられる場合、1kgの種子に対して0.001~50gの式Iの化合物、好ましくは、1kgの種子に対して0.01~10gの量が一般に十分とされる。

【0245】

好適には、本発明に係る式(I)の化合物を含む組成物は、病害の発生前を意味する予防的に、または、病害の発生後を意味する治療的に適用される。

【0246】

50

本発明の組成物は、いずれかの従来形態、例えば、二液系、乾燥種子処理用粉末（D S）、種子処理用エマルジョン（E S）、種子処理用流動性濃縮物（F S）、種子処理用溶液（L S）、種子処理用水分散性粉末（W S）、種子処理用カプセル懸濁液（C F）、種子処理用ゲル（G F）、エマルジョン濃縮物（E C）、懸濁液濃縮物（S C）、サスペンション（S E）、カプセル懸濁液（C S）、水分散性顆粒（W G）、乳化性顆粒（E G）、エマルジョン、油中水型（E O）、エマルジョン、水中油型（E W）、マイクロエマルジョン（M E）、油分散体（O D）、油混和性の流動体（O F）、混油性液体（O L）、可溶性濃縮物（S L）、超低体積懸濁液（S U）、超低体積液体（U L）、工業用濃縮物（T K）、分散性濃縮物（D C）、水和剤（W P）、または、農学的に許容可能な補助剤と組み合わせられるいずれかの技術的に好ましい配合物の形態で採用され得る。

10

【0247】

このような組成物は、従来様式で、例えば活性成分を、適切な不活性配合物（希釈剤、溶剤、充填材、ならびに、界面活性剤、殺生剤、不凍剤、展着剤、増粘剤およびアジュバント活性効果をもたらす化合物などの任意により他の配合成分）と混合することにより、生成され得る。また、従来緩効性配合物は、長期にわたって持続する効力が意図される場合に採用され得る。特に、水分散性濃縮物（例えばE C、S C、D C、O D、S E、E W、E O等）、水和剤および顆粒などの吹付け形態で適用される配合物は、例えばホルムアルデヒドとナフタレンスルホン酸塩との縮合物、アルキルアリアルスルホネート、リグニンスルホン酸塩、脂肪アルキルスルフェート、およびエトキシ化アルキルフェノールおよびエトキシ化脂肪族アルコールといった、湿潤剤および分散剤およびアジュバント効果をもたらす他の化合物などの界面活性剤を含有していてもよい。

20

【0248】

種子粉衣配合物は種子にそれ自体公知である様式で適用され、例えば水性懸濁液または種子に良好な接着性を有する乾燥粉末形態といった好適な種子粉衣配合物形態で、本発明の組み合わせおよび希釈剤を利用する。このような種子粉衣配合物は技術分野において公知である。種子粉衣配合物は、単一種の活性成分を含有していても、または、例えば緩効性カプセルもしくはマイクロカプセルとしてカプセル化形態で活性成分の組み合わせを含有していてもよい。

【0249】

普通、配合物は、0.01~90重量%の活性薬剤、0~20%の農学的に許容可能な界面活性剤、ならびに、10~99.99%の固体または液体不活性配合物および補助剤を含み、活性薬剤は、少なくとも式（I）の化合物を、コンポーネント（B）および（C）、および、任意により他の活性薬剤、特に殺菌剤または防腐剤等を一緒に伴って構成されている。組成物の濃縮形態は、一般に、約2~80%、好ましくは約5~70重量%の活性薬剤を含有する。配合物の適用形態は、例えば0.01~20重量%、好ましくは0.01~5重量%の活性薬剤を含有し得る。市販製品は濃縮物として配合されていることが好ましいであろうが、エンドユーザーは通常希釈した配合物を利用することとなる。

30

【0250】

市販の製品を濃縮物として配合することが好ましいが、エンドユーザーは通常配合物を希釈して使用するであろう。

40

【実施例】

【0251】

以下の実施例は本発明を例示するものである。本発明の一定の化合物は低施用量でのより高い効力により公知の化合物から区別可能であり、これは、実施例において概説されている実験手法を用い、必要に応じて、例えば50ppm、12.5ppm、6ppm、3ppm、1.5ppm、0.8ppmまたは0.2ppmといったより少ない施用量を用いることで当業者により検証可能である。

【0252】

本記載を通じて、温度は摂氏度で示されており、「m.p.」は融点を意味する。LC/MSは液体クロマトグラフィ質量分析を意味し、用いた装置および方法の説明は以下の

50

とおりである。

【0253】

方法G：

スペクトルを、エレクトロスプレーソース（極性：陽イオンまたは陰イオン、キャピラリー：3.00 kV、コーン範囲：30～60 V、抽出器：2.00 V、ソース温度：150、脱溶媒温度：350、コーンガス流：0 L/Hr、脱溶媒ガス流：650 L/Hr、質量範囲：100～900 Da）およびWaters製Acquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメントおよびダイオード-アレイ検出器を備えるWaters製の質量分光計（ACQUITY UPLC）（SQD、SQDIIまたはZQシングル四重極型質量分析計）で記録した。溶剤デガッサ、バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメントおよびダイオード-アレイ検出器。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8 μm、30×2.1 mm、温度：60、DAD波長範囲（nm）：210～500、溶剤勾配：A = 水 + 5% MeOH + 0.05% HCOOH、B = アセトニトリル + 0.05% HCOOH、勾配：1.2分間で10～100% B；流量（ml/min）0.85

10

【0254】

方法H：

スペクトルを、エレクトロスプレーソース（極性：陽イオンまたは陰イオン、キャピラリー：3.00 kV、コーン範囲：30～60 V、抽出器：2.00 V、ソース温度：150、脱溶媒温度：350、コーンガス流：0 L/Hr、脱溶媒ガス流：650 L/Hr、質量範囲：100～900 Da）およびWaters製Acquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメントおよびダイオード-アレイ検出器を備えるWaters製の質量分光計（ACQUITY UPLC）（SQD、SQDIIまたはZQシングル四重極型質量分析計）で記録した。溶剤デガッサ、バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメントおよびダイオード-アレイ検出器。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8 μm、30×2.1 mm、温度：60、DAD波長範囲（nm）：210～500、溶剤勾配：A = 水 + 5% MeOH + 0.05% HCOOH、B = アセトニトリル + 0.05% HCOOH、勾配：2.7分間で10～100% B；流量（ml/min）0.85

20

【0255】

配合物実施例

30

【0256】

【表3】

水和剤

活性処方成分[式(I)の化合物]

リグノスルホン酸ナトリウム

ラウリル硫酸ナトリウム

ナトリウムジイソブチルナフタレンスルホネート

フェノールポリエチレングリコールエーテル

(7～8 molのエチレンオキシド)

高分散ケイ酸

カオリン

	a)	b)	c)
活性処方成分[式(I)の化合物]	25%	50%	75%
リグノスルホン酸ナトリウム	5%	5%	-
ラウリル硫酸ナトリウム	3%	-	5%
ナトリウムジイソブチルナフタレンスルホネート	-	6%	10%
フェノールポリエチレングリコールエーテル	-	2%	-
高分散ケイ酸	5%	10%	10%
カオリン	62%	27%	-

40

【0257】

活性成分を補助剤と十分に混合すると共に混合物を好適なミルで十分に粉碎して、水で希釈された所望の濃度の懸濁液をもたらすことが可能である水和剤を得た。

【0258】

【表4】

乾燥種子処理に係る粉末

	a)	b)	c)
活性処方成分[式(I)の化合物]	25%	50%	75%
軽質鉱油	5%	5%	5%
高分散ケイ酸	5%	5%	-
カオリン	65%	40%	-
タルカム	-	-	20

【0259】

10

活性成分を補助剤と十分に混合すると共に混合物を好適なミルで十分に粉砕して、種子処理に直接用いることが可能である粉末を得た。

【0260】

乳化性濃縮物

活性成分[式(I)の化合物]	10%		
オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル (4~5molのエチレンオキシド)	3%		
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	3%		
ヒマシ油ポリグリコールエーテル(35molのエチレンオキシド)		4%	
シクロヘキサノン	30%		20
キシレン混合物	50%		

【0261】

植物の保護において用いられることが可能である、任意の必要とされる希釈率のエマルジョンを、この濃縮物から水による希釈で得ることが可能である。

【0262】

【表5】

粉剤

活性処方成分[式(I)の化合物]

	a)	b)	c)
活性処方成分[式(I)の化合物]	5%	6%	4%
タルカム	95%	-	-
カオリン	-	94%	-
無機充填材	-	-	96%

30

【0263】

すぐに使用可能な粉剤は、活性成分とキャリアとを混合し、この混合物を好適なミルで粉砕することにより得られる。このような粉末は、種子の乾燥粉衣に用いられることも可能である。

【0264】

押し出し顆粒

活性成分[式(I)の化合物]	15%		40
リグノスルホン酸ナトリウム	2%		
カルボキシメチルセルロース	1%		
カオリン	82%		

【0265】

活性成分を補助剤と混合および粉砕し、この混合物を水で湿らせる。この混合物を押し出し、次いで、空気流中で乾燥させる。

【0266】

コーティングされた顆粒

活性成分[式(I)の化合物]	8%		
ポリエチレングリコール(mol.wt.200)	3%		50

カオリン 89%

【0267】

細かく粉砕した活性成分を、ミキサ中において、ポリエチレングリコールで湿らせたカオリンに均一に適用する。粉末を発生しないコーティングされた顆粒がこのようにして得られる。

【0268】

懸濁液濃縮物

活性成分[式(I)の化合物] 40%

プロピレングリコール 10%

ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル(15 molのエチレンオキシド) 10
6%

リグノスルホン酸ナトリウム 10%

カルボキシメチルセルロース 1%

シリコン油(75%水中エマルジョンの形態) 1%

水 32%

【0269】

細かく粉砕した活性成分を補助剤と均質に混合して懸濁液濃縮物を得、水で希釈することによって、この懸濁液を任意の所望の濃度で得ることが可能である。このような希釈を用いることで、吹付け、注ぎかけ、または、浸漬により、微生物による外寄生から、生存している植物ならびに植物繁殖体を処理および保護可能である。

【0270】

種子処理に係る流動性濃縮物

活性成分[式(I)の化合物] 40%

プロピレングリコール 5%

コポリマーブタノール PO/EO 2%

10~20モルのEOを伴うトリスチレンフェノール 2%

1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン(20%水溶液の形態) 0.5%

モノアゾ-顔料カルシウム塩 5%

シリコン油(75%水中エマルジョンの形態) 0.2%

水 45.3%

【0271】

細かく粉砕した活性成分を補助剤と均質に混合して懸濁液濃縮物を得、水で希釈することによって、この懸濁液を任意の所望の濃度で得ることが可能である。このような希釈を用いることで、吹付け、注ぎかけ、または、浸漬により、微生物による外寄生から、生存している植物ならびに植物繁殖体を処理および保護可能である。

【0272】

緩効性カプセル懸濁液

28部の組み合わせた式(I)の化合物を、2部の芳香族溶剤および7部のトルエンジイソシアネート/ポリメチレン-ポリフェニルイソシアネート混合物(8:1)と混合する。この混合物を、1.2部のポリビニルアルコール、0.05部の脱泡剤および51.6部の水の混合物中において、所望の粒径が達成されるまで乳化させる。このエマルジョンに、5.3部の水中の2.8部の1,6-ジアミノヘキサンの混合物を添加する。この混合物を、重合反応が完了するまで攪拌する。

【0273】

得られるカプセル懸濁液を、0.25部の増粘剤および3部の分散剤を添加することにより安定化させる。カプセル懸濁液配合物は、28%の活性成分を含有する。中程度のカプセル径は8~15ミクロンである。

【0274】

得られる配合物を、目的に好適な装置中において、水性懸濁液として種子に適用する。

【0275】

調製例

上記および下記の両方の技術を用いて、式 (I) の化合物を調製し得る。

【 0 2 7 6 】

実施例 1 : この実施例は、5 - フルオロ - 1 - [8 - フルオロイミダゾ (1 , 2 - a) ピリミジン - 3 - イル] - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - イソキノリンの調製を例示する
ステップ 1 : N ' - (3 - フルオロ - 2 - ピリジル) - N , N - ジメチル - ホルムアミジン

15 ml のメタノール中の 1.50 g (13.4 mmol) の 2 - アミノ - 3 - フルオロ - ピリジンおよび 1.99 g (16.2 mmol) の N , N - ジメチルホルムアミドジメチルアセタールを、還流下で 2 時間加熱した。反応混合物を減圧下で濃縮し、残渣を、
フラッシュクロマトグラフィ (ヘプタン / 酢酸エチル = 1 : 1) により精製して、N ' - (3 - フルオロ - 2 - ピリジル) - N , N - ジメチル - ホルムアミジンを無色の油として得た。

【 0 2 7 7 】

ステップ 2 : 8 - フルオロイミダゾ (1 , 2 - a) ピリミジン - 3 - カルボニトリル

30 ml のイソプロパノール中の 2.11 g (12.6 mmol) の N ' - (3 - フルオロ - 2 - ピリジル) - N , N - ジメチル - ホルムアミジンに、1.54 g (18.3 mmol) の重炭酸ナトリウムおよび 1.1 ml (14.9 mmol) のプロモアセトニトリルを添加し、混合物を 80 で一晩撹拌した。反応混合物を濃縮し、水 / 酢酸エチルで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮した。この残渣を、フラッシュクロマトグラフィ (ヘプタン / 酢酸エチル = 1 : 1) により精製して、8 - フルオロイミダゾ (1 , 2 - a) ピリミジン - 3 - カルボニトリルを油として得、これを、ベージュ色の粉末 (融点 157 ~ 158) として、t - ブチルメチルエーテル / ヘプタン (1 : 2) から結晶化させた。

【 0 2 7 8 】

ステップ 3 : 5 - フルオロ - 1 - (8 - フルオロイミダゾ (1 , 2 - a) ピリミジン - 3 - イル) - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - イソキノリン

0.13 g (0.80 mmol) の 8 - フルオロイミダゾ (1 , 2 - a) ピリミジン - 3 - カルボニトリルの 1.8 ml の濃硫酸中の冷却した懸濁液 (0) に、0.17 g (0.89 mmol) の 3 - (2 - フルオロフェニル) - 2 , 3 - ジメチル - ブタン - 2 - オールを 20 分以内に添加し、混合物を 1 時間、この温度で撹拌した。反応混合物を氷水に注ぎ入れ、水酸化ナトリウムを用いて pH を 8 に調節した。水性相を酢酸エチルで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮した。この残渣を、フラッシュクロマトグラフィ (ヘプタン / 酢酸エチル = 4 : 1) により精製して、5 - フルオロ - 1 - (8 - フルオロイミダゾ (1 , 2 - a) ピリミジン - 3 - イル) - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - イソキノリンをベージュ色の粉末 (融点 156 ~ 157) として得た。

【 0 2 7 9 】

3 - (2 - フルオロフェニル) - 2 , 3 - ジメチル - ブタン - 2 - オールの調製

ステップ 1 : エチル - 2 - (2 - フルオロフェニル) - 2 - メチル - プロパノエート

27.4 g (0.69 mol) の水素化ナトリウムの 220 ml のテトラヒドロフラン中の懸濁液に、50.0 g (0.27 mol) のエチル - 2 - (2 - フルオロフェニル) アセテートおよび 117.9 g (0.82 mmol) のヨードメタンの 60 ml のテトラヒドロフラン中の混合物を、室温で滴下した。一晩撹拌した後、70 ml の塩化アンモニウム飽和溶液をゆっくりと添加した。反応混合物を 300 ml の氷水に注ぎ入れ、酢酸エチルで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮した。この残渣を、フラッシュクロマトグラフィ (ヘプタン / 酢酸エチル = 19 : 1) により精製して、エチル - 2 - (2 - フルオロフェニル) - 2 - メチル - プロパノエートを黄色がかった油として得た。

【 0 2 8 0 】

ステップ 2 : 3 - (2 - フルオロフェニル) - 2 , 3 - ジメチル - ブタン - 2 - オール

52.1 g (0.25 mol) のエチル - 2 - (2 - フルオロフェニル) - 2 - メチル

- プロパノエートおよび 207 ml (0.12 mol) のランタン (III) クロリドビス (塩化リチウム) 錯体溶液 (THF 中に 0.6 M) を、1.5 時間、室温で攪拌した。次いで、248 ml (0.74 mol) のメチルマグネシウムブロミド溶液 (ジエチルエーテル中に 3.0 M) を 0 で滴下した。一晩攪拌した後、室温で 60 ml の塩化アンモニウム飽和溶液を冷却しながらゆっくりと添加した。200 ml の水を添加し、攪拌を 30 分間継続した。反応混合物を t-ブチルメチルエーテルで抽出し、セライトでろ過し、相を分離し、水相を t-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機相を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、3-(2-フルオロフェニル)-2,3-ジメチル-ブタン-2-オールを黄色がかった固体 (融点 42 ~ 43) として得た。

【0281】

実施例 2 : この実施例は、5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-1-ピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-イル-イソキノリンの調製を例示する

ステップ 1 : ピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-カルボニトリル

0.2 g (0.8967 mmol) のピリジン-1-イウム-1-アミンヨウ化水素酸塩および 0.18 g (1.3003 mmol) の炭酸カリウムの 2 mL の N,N-ジメチルホルムアミド中の溶液に、0.085 mL (0.9869 mmol, 0.082 g) の (E)-3-メトキシプロブ-2-エンニトリルを室温で滴下した。反応混合物を 80 で一晩攪拌した。反応混合物を減圧下で濃縮し、残渣をジエチルエーテル/水で抽出した。組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。この残渣を、フラッシュクロマトグラフィ (シクロヘキサン/酢酸エチル = 1 : 1) により精製して、0.07 g (0.489 mmol) のピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-カルボニトリルをベージュ色の固体 (融点 124 ~ 127) として得た。

【0282】

ステップ 2 : 5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-1-ピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-イル-イソキノリン

0.07 g (0.489 mmol) のピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-カルボニトリルの 0.8 mL の硫酸中の溶液に、0.115 g (0.5868 mmol) の 3-(2-フルオロフェニル)-2,3-ジメチル-ブタン-2-オールを 0 で滴下した。反応混合物を 0 で 3 時間攪拌し、次いで、これを冷水に注ぎ入れ、8 M の NaOH で pH 10 に塩基化し、ジクロロメタンで 3 回洗浄した。有機相を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。この残渣を、フラッシュクロマトグラフィ (シクロヘキサン/酢酸エチル = 3 : 1) により精製して、0.0573 g (0.169 mmol) の 5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-1-ピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-イル-イソキノリンをベージュ色の固体 (融点 105 ~ 108) として得た。

【0283】

実施例 3 : この実施例は、4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-1-(8-メチルイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル)イソキノリンの調製を例示する

ステップ 1 : 1-(8-プロモイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン

氷冷した (0)、1.00 g (4.50 mmol) の 8-プロモイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-カルボニトリルの 9.8 mL の濃硫酸中の溶液に、1.01 g (6.76 mmol) の 2-メチル-1-フェニル-プロパン-2-オールを 15 分間かけてゆっくりと添加し、得られた溶液をさらに 60 分間、0 ~ 5 で攪拌した。反応混合物を氷水に注ぎ入れ、4 N 水酸化ナトリウム溶液で pH を 9 に調節した。水性相を酢酸エチルで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。この残渣を、フラッシュクロマトグラフィ (ヘプタン/酢酸エチル = 3 : 1) により精製して、1.04 g (2.94 mmol) の 1-(8-プロモイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-4H-イソキノリンを明るい黄色の粉末として得た。

【0284】

10

20

30

40

50

ステップ2：1 - (8 - プロモイミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル) - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オン

0.625 g (1.77 mmol) の1 - (8 - プロモイミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル) - 3 , 3 - ジメチル - 4 H - イソキノリンの50 mLの四塩化炭素中の溶液に、0.661 g (3.52 mmol) のN - プロモスクシンイミドおよび0.076 g (0.44 mmol) のアゾイソブチロニトリルを室温で添加した。得られた混合物を77 に温め、120分間、この温度で攪拌した。室温に冷却した後、反応をジクロロメタンで希釈し、水および塩水で順次に洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。この残渣を、フラッシュクロマトグラフィ (ヘプタン / 酢酸エチル = 2 : 1) により精製して、0.634 g (1.73 mmol) の1 - (8 - プロモイミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル) - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オンをオフホワイトの固体 (融点204 ~ 208) として得た。

10

【0285】

ステップ3：1 - (8 - プロモイミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル) - 4 , 4 - ジフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン

0.33 g (0.81 mmol) の1 - (8 - プロモイミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル) - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オンを0.51 mLの2,2 - ジフルオロ - 1,3 - ジメチルイミダゾリン中に室温で懸濁させ、100 に温め、この温度で一晩攪拌した。得られた溶液を室温に冷却し、氷冷した重炭酸塩飽和溶液にゆっくりと添加した。この混合物を酢酸エチルで抽出し；有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。この残渣を、フラッシュクロマトグラフィ (トルエン / 酢酸エチル = 1 : 0 ~ 9 : 1) により精製して、0.136 g (0.35 mmol) の1 - (8 - プロモイミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル) - 4 , 4 - ジフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリンを白色の固体 (融点173) として得た。

20

【0286】

ステップ4：4,4 - ジフルオロ - 3,3 - ジメチル - 1 - (8 - メチルイミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル) イソキノリン

0.09 g (0.23 mmol) の1 - (8 - プロモイミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル) - 4,4 - ジフルオロ - 3,3 - ジメチル - イソキノリンの3 mLのジオキサン (脱気後) 中の溶液に、0.072 mL (0.25 mmol) のトリメチルボロキシン (THF中に3.5 M)、0.307 g (0.92 mmol) の炭酸セシウムおよび0.020 g (0.02 mmol) の [Pd (d p p f) Cl₂] を室温で添加した。得られた懸濁液を95 に温め、90分間、この温度で維持した。室温に冷却した後、反応を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。この残渣をフラッシュクロマトグラフィ (ヘプタン / 酢酸エチル = 3 : 2 ~ 2 : 1) により精製して、0.073 g (0.22 mmol) の4,4 - ジフルオロ - 3,3 - ジメチル - 1 - (8 - メチルイミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル) イソキノリンを明るい茶色の油として得た。

30

【0287】

実施例4：この実施例は、1 - (6,7 - ジメチルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 3 - イル) - 4,4 - ジフルオロ - 3,3 - ジメチル - イソキノリンの調製を例示する

40

ステップ1：3,3 - ジメチル - 2 H - イソキノリン - 1,4 - ジオンの調製

1) 3,3 - ジメチル - 2,4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - オン (57.1 mmol、10.0 g) のCCl₄ (285 mL) 中の溶液に、室温で、N - プロモスクシンイミド (171 mmol、30.5 g) およびAIBN (8.5 mmol、1.43 g) を添加し、反応混合物を70 で3時間攪拌した。反応混合物を室温に冷却し、減圧下で濃縮し、EtOAcで希釈し、水および塩水で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、濃縮して、4,4 - ジプロモ - 3,3 - ジメチル - 2 H - イソキノリン - 1 - オン (25.2 g) を、明るい黄色の固体として得、これを、次のステップにおいてさらに精製することなく直接用いた：LC - MS (方法H) UV検出：220 nm、Rt = 1.34 ; MS

50

: (M + 1) = 332 - 334 - 336; ¹H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) ppm 1.57 (s, 6H) 7.21 (br. s, 1H) 7.70 - 7.77 (m, 1H) 7.78 - 7.85 (m, 1H) 8.06 - 8.14 (m, 1H) 8.23 - 8.30 (m, 1H).

【0288】

2) 4, 4 - ジブプロモ - 3, 3 - ジメチル - 2H - イソキノリン - 1 - オン (20.0 g) の水 (450 mL) およびテトラヒドロフラン (225 mL) の混合物中の溶液に炭酸ナトリウム (135 mmol, 14.3 g) を添加し、混合物を室温で12時間、および、70 で4時間30分撹拌した。反応混合物を室温に冷却し、水で希釈し、90 mL の2 M 塩酸溶液でpH 3 ~ 4に酸性化し、ジクロロメタンで抽出した。組み合わせた有機抽出物をNa₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、濃縮して、3, 3 - ジメチル - 2H - イソキノリン - 1, 4 - ジオン (9.95 g) を、黄色の固体として得た: LC - MS (方法H) UV検出: 220 nm、Rt = 0.81; MS: (M + 1) = 190; ¹H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) ppm 1.77 (s, 3H) 1.97 (s, 3H) 7.39 (s, 1H) 7.46 - 7.58 (m, 1H) 7.60 - 7.71 (m, 1H) 7.98 - 8.22 (m, 2H).

10

【0289】

ステップ2: 1 - クロロ - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オンの調製。

N, N - ジメチルホルムアミド (2.3 mL, 30 mmol) のジクロロメタン (52 mL) 中の溶液に、室温で、塩化オキサリル (20 mmol, 1.8 mL) を35分間かけて滴下し、白色の懸濁液を、ガスの発生が停止するまで15分間激しく撹拌した。次いで、3, 3 - ジメチル - 2H - イソキノリン - 1, 4 - ジオン (2.5 g, 13 mmol) のジクロロメタン (25 mL) 中の溶液を滴下し、混合物を室温で1時間撹拌した。反応混合物を飽和NaHCO₃水溶液およびペンタンの氷冷した混合物中に注ぎ入れ、有機相を分離した。次いで、水性相をペンタンで抽出し、組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、濃縮して、1 - クロロ - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オン (2.5 g) を、黄色の固体として得た: LC - MS (方法H) UV検出: 220 nm、Rt = 1.34; MS: (M + 1) = 208 - 210; ¹H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) ppm 1.47 (s, 6H) 7.62 - 7.69 (m, 1H) 7.73 - 7.81 (m, 1H) 7.90 (dd, J = 8.07, 0.73 Hz, 1H) 8.04 (dd, J = 7.50, 0.90 Hz, 1H).

20

30

【0290】

ステップ3: 3, 3 - ジメチル - 1 - (2 - トリメチルシリルエチニル) イソキノリン - 4 - オンの調製

1 - クロロ - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オン (2.10 g, 9.1 mmol) のトリエチルアミン (20 mL) 中の溶液に、室温で、CuI (0.17 g, 0.9 mmol)、ビス - トリフェニルホスフィンパラジウム (II) ジクロリド (320 mg, 0.46 mmol) を添加し、続いて、エチニルトリメチルシラン (1.9 mL, 14 mmol) を滴下した。黒色の溶液を室温で1時間撹拌した。反応混合物を飽和水性NH₄Clで失活させ、酢酸エチルで2回抽出した。有機相を塩水で洗浄し、無水Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。フラッシュクロマトグラフィによる精製で、3, 3 - ジメチル - 1 - (2 - トリメチルシリルエチニル) イソキノリン - 4 - オン (2.35 g) を、濃い黄色の油として得た: LC - MS (方法G)、Rt = 1.21、UV検出: 220 nm; MS: (M + 1) = 270; ¹H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) ppm 0.32 (s, 9H) 1.51 (s, 6H) 7.63 - 7.69 (m, 1H) 7.79 - 7.83 (m, 1H) 7.98 (dd, 2H) 8.05 (dd, 1H).

40

【0291】

ステップ4: 1 - エチニル - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オンの調製。

3, 3 - ジメチル - 1 - (2 - トリメチルシリルエチニル) イソキノリン - 4 - オン (1.0 g, 3.7 mmol) のメタノール (7.5 mL) 中の溶液に、室温で、K₂CO₃

50

(570 mg、4.1 mmol) を添加した。反応混合物を室温で1時間攪拌し、水 (pH 8/9) で失活させ、酢酸エチルで2回抽出した。組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、無水 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。フラッシュクロマトグラフィによる精製で、1-エチニル-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オン (700 mg) を、茶色の油として得た：LC-MS (方法G)、 $R_t = 0.84$ 、UV検出：220 nm；MS：(M+1) = 198； ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) ppm 1.50 (s, 6H) 3.28 (s, 1H) 7.65 - 7.70 (m, 1H) 7.79 - 7.85 (m, 1H) 7.98 - 8.04 (m, 1H) 8.06 - 8.12 (s, 1H)。

【0292】

ステップ5：1-(6,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オンの調製。

2,3-ジメチルピリジン-1-イウム-1-アミンヨージド (1.0 g、4.1 mmol) のジクロロメタン (20 mL) 中の白色の懸濁液に、ジアザピシクロウンデセン (623 mg、4.1 mmol) を添加し、続いて、ジクロロメタン (10 mL) 中に溶解した1-エチニル-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オン (700 mg、3.2 mmol) を30分間かけて滴下した。得られた茶色の混合物を室温で1時間、1-エチニル-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オン出発材料が消失するまで攪拌した。反応混合物を水で失活させ、有機相を分離し、飽和水性 NH_4Cl で洗浄した。水相をジクロロメタンで抽出した。組み合わせた有機相を水および塩水で洗浄し、無水 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。フラッシュクロマトグラフィによる精製で、1-(6,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オン (410 mg) をオレンジ色の固体として得た：mp = 152° ~ 153、LC-MS (方法G)、 $R_t = 0.86$ 、UV検出：220 nm；MS：(M+1) = 318； ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) ppm 1.57 (s, 6H) 2.42 (s, 3H) 2.72 (s, 3H) 7.15 (d, 1H) 7.62 - 7.85 (m, 3H) 8.15 (d, 1H) 8.35 (s, 1H)。

【0293】

ステップ6：1-(6,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリンの調製

1-(6,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オン (370 mg、1.2 mmol) の2,2-ジフルオロ-1,3-ジメチルイミダゾリジン (14 mmol、1.8 mL) 中の溶液を105°Cで24時間攪拌した。反応混合物を室温に冷却し、ジクロロメタンで希釈し、次いで、氷冷 NaHCO_3 飽和水溶液をゆっくりと添加することにより失活させた。2つの相を分離し、水性相をDCMで抽出した。組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。この残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、1-(6,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン (328 mg) を、ベージュ色の固体として得た：mp = 160 ~ 161、LC-MS (方法G) UV検出：220 nm、 $R_t = 1.03$ 、MS：(M+1) = 340； ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) ppm 1.42 (s, 6H) 2.40 (s, 3H) 2.79 (s, 3H) 7.15 (d, 1H) 7.57 - 7.68 (m, 2H) 7.72 (d, 1H) 7.85 (d, 1H) 7.94 (d, 1H) 8.21 (s, 1H)。 ^{19}F NMR (400 MHz, クロロホルム-d) ppm -112。

【0294】

実施例5：この実施例は、1-(6,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-4,4,6-トリフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリンの調製を例示する

ステップ1：6-フルオロ-3,3-ジメチル-2H-イソキノリン-1,4-ジオンの

10

20

30

40

50

調製

3, 3 - ジメチル - 2 H - イソキノリン - 1, 4 - ジオン 6 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - 2 H - イソキノリン - 1, 4 - ジオン (実施例 4、ステップ 1) に記載のものと同様の合成経路を介して調製を行った:

LC - MS (方法 H) UV 検出: 220 nm、Rt = 0.94; MS: (M + 1) = 208; ¹H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) ppm 1.56 (s, 6H) 7.35 (br. s, 1H) 7.43 - 7.50 (m, 1H) 7.68 - 7.74 (m, 1H) 8.25 - 8.30 (m, 1H). ¹⁹F (400 MHz, クロロホルム - d) ppm - 103

【0295】

ステップ 2: 1 - クロロ - 6 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オンの調製

N, N - ジメチルホルムアミド (1.6 mL, 21 mmol) のジクロロメタン (36 mL) 中の溶液に、室温で、塩化オキサリル (14 mmol, 1.6 mL) を 30 分間かけて滴下し、白色の懸濁液を 25 分間、ガスの発生が停止するまで激しく攪拌した。次いで、6 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - 2 H - イソキノリン - 1, 4 - ジオン (2.0 g, 9.7 mmol) のジクロロメタン (20 mL) 中の溶液を 0 で滴下した。混合物を周囲温度に温め、1 時間攪拌した。反応混合物を氷冷した NaHCO₃ 飽和水溶液およびペンタンの混合物に注ぎ入れ、有機相を分離した。次いで、水性相をペンタンで抽出し、組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、Na₂SO₄ で乾燥させ、ろ過し、濃縮して、1 - クロロ - 6 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オン (1.95 g) を濃い黄色の油として得、これを、精製することなく次の合成ステップにおいて用いた: LC - MS (方法 H) UV 検出: 220 nm、Rt = 1.42; MS: (M + 1) = 226 - 228

【0296】

ステップ 3: 6 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - 1 - (2 - トリメチルシリルエチニル) イソキノリン - 4 - オンの調製

1 - クロロ - 6 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オン (1.4 g, 6.0 mmol) のトリエチルアミン (12 mL) 中の溶液に、室温で、CuI (116 mg, 0.6 mmol)、ビス - トリフェニルホスフィンパラジウム (II) ジクロリド (214 mg, 0.3 mmol) を添加し、続いて、エチニルトリメチルシラン (1.3 mL, 9.1 mmol) を滴下した。黒色の溶液を室温で一晩攪拌した。反応混合物を飽和水性 NH₄Cl で失活させ、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機相を塩水で洗浄し、無水 Na₂SO₄ で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。フラッシュクロマトグラフィによる精製で、6 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - 1 - (2 - トリメチルシリルエチニル) イソキノリン - 4 - オン (1.25 g) を、オレンジ色の固体として得た: LC - MS (方法 G)、Rt = 1.22、UV 検出: 220 nm; MS: (M + 1) = 288; ¹H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) ppm 0.32 (s, 9H) 1.52 (s, 6H) 7.47 - 7.52 (m, 1H) 7.70 - 7.76 (m, 1H) 8.0 - 8.05 (m, 1H). ¹⁹F (400 MHz, クロロホルム - d) ppm - 104.

【0297】

ステップ 4: 1 - エチニル - 6 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オンの調製。

6 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - 1 - (2 - トリメチルシリルエチニル) イソキノリン - 4 - オン (1.25, 4.3 mmol) のジクロロメタン (17 mL) 中の溶液に、室温で、フッ化カリウム (0.56 g, 9.6 mmol) および 18 - クラウン - 6 (1.2 g, 4.3 mmol) を添加した。反応混合物を室温で 30 分間攪拌し、飽和水性 NaHCO₃ で失活させ、ジクロロメタンで 2 回抽出した。組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、無水 Na₂SO₄ で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。フラッシュクロマトグラフィによる精製で、1 - エチニル - 6 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オン。

10

20

30

40

50

(610 mg) を、茶色の油として得た：LC-MS (方法G)、 $R_t = 0.90$ 、UV 検出：220 nm；MS：(M+1) = 216； ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) ppm 1.53 (s, 6H) 3.31 (s, 1H) 7.46 - 7.52 (m, 1H) 7.70 - 7.75 (m, 1H) 8.02 - 8.07 (m, 1H)。 ^{19}F (400 MHz, クロロホルム-d) ppm -103

【0298】

ステップ5：1-(6,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-6-フルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オンの調製

2,3-ジメチルピリジン-1-イウム-1-アミン2,4,6-トリメチルベンゼンスルホネート(750 mg、2.3 mmol)のジメチルホルムアミド(8 mL)中の溶液に、先ず炭酸カリウム(490 mg、3.5 mmol)を添加し、続いて、ジメチルホルムアミド(4 mL)中に溶解した1-エチニル-6-フルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オン(600 mg、2.8 mmol)を、30分間かけて滴下した。得られた茶色の混合物を室温で2日間、1-エチニル-5-フルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オン出発材料が消失するまで撹拌した。反応混合物を水で失活させ、酢酸エチルで2回抽出した。組み合わせた有機相を水および塩水で洗浄し、無水 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。フラッシュクロマトグラフィによる精製で、1-(6,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-6-フルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オン(295 mg)を、茶色の固体として得た：mp = 168~170、LC-MS (方法G)、 $R_t = 0.92$ 、UV 検出：220 nm；MS：(M+1) = 336； ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) ppm 1.60 (s, 6H) 2.45 (s, 3H) 2.80 (s, 3H) 7.18 (d, 1H) 7.39 - 7.48 (m, 1H) 7.73 - 7.95 (m, 3H) 8.23 (br s, 1H)。 ^{19}F NMR (400 MHz, クロロホルム-d) ppm -106

【0299】

ステップ6：1-(6,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-4,4,6-トリフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリンの調製

1-(6,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-6-フルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オン(280 mg、0.84 mmol)の2,2-ジフルオロ-1,3-ジメチルイミダゾリジン(1.3 mL)中の溶液を105°Cで24時間撹拌した。反応混合物を室温に冷却し、ジクロロメタンで希釈し、次いで、氷冷 NaHCO_3 飽和水溶液をゆっくりと添加することにより失活させた。2つの相を分離し、水性相をDCMで抽出した。組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。この残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、1-(6,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-4,4,6-トリフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン(235 mg)を、ベージュ色の固体として得た：mp = 183~185、LC-MS (方法G) UV 検出：220 nm、 $R_t = 1.09$ 、MS：(M+1) = 358； ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) ppm 1.45 (s, 6H) 2.45 (s, 3H) 2.80 (s, 3H) 7.19 (d, 1H) 7.22 - 7.27 (m, 1H) 7.55 (dd, 1H) 7.72 - 7.77 (m, 1H) 7.95 (d, 1H) 8.21 (br s, 1H)。 ^{19}F NMR (400 MHz, クロロホルム-d) ppm -106, -113。

【0300】

実施例6：この実施例は、1-(6,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-4,4,5-トリフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリンを例示する。

ステップ1：5-フルオロ-3,3-ジメチル-2H-イソキノリン-1,4-ジオンの調製

1) 5-フルオロ-3,3-ジメチル-2,4-ジヒドロイソキノリン-1-オン(5.0 g、25.9 mmol)の CCl_4 (100 mL)中の溶液に、室温で、N-プロモスクシンイミド(44 mmol、7.9 g)およびAIBN(2.6 mmol、0.43

10

20

30

40

50

g) を添加し、反応混合物を 70 で 2 時間、出発材料が消失するまで撹拌した。反応混合物を室温に冷却し、減圧下で濃縮し、酢酸エチルで希釈し、水および塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、濃縮して、4 - プロモ - 5 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - 2, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - オン (6.6 g) を、明るい黄色の固体として得、これを、次のステップにおいてさらに精製することなく直接用いた：LC - MS (方法 G) UV 検出：220 nm、 $R_t = 0.83$ ；MS：(M + 1) = 272 - 274； ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) ppm 1.30 (s, 3H) 1.55 (s, 3H) 5.30 (s, 1H) 6.15 (br. s, 1H) 7.24 - 7.30 (m, 1H) 7.40 - 7.50 (m, 1H) 7.90 (d, 1H)。 ^{19}F NMR (400 MHz, クロロホルム - d) ppm - 119

10

【0301】

2) 4 - プロモ - 5 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - 2, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - オン (6.6 g) の水 (120 mL) およびテトラヒドロフラン (120 mL) の混合物中の溶液を 90 で一晩撹拌した。反応混合物を室温に冷却し、飽和水性 NaHCO_3 で pH 7 ~ 8 に希釈し、酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機抽出物を Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。フラッシュクロマトグラフィによる精製で、5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチル - 2, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - オン (3.54 g) を、白色の固体として得た：LC - MS (方法 G) UV 検出：220 nm、 $R_t = 0.60$ ；MS：(M + 1) = 210； ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) ppm 1.20 (s, 3H) 1.50 (s, 3H) 2.5 (br. d, 1H) 4.7 (d, 1H) 5.75 (br. s, 1H) 7.27 - 7.30 (m, 1H) 7.40 - 7.48 (m, 1H) 7.85 (d, 1H)。 ^{19}F NMR (400 MHz, クロロホルム - d) ppm - 113

20

【0302】

3) 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 3, 3 - ジメチル - 2, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - オン (3.54 g, 16.9 mmol) のジクロロメタン (200 mL) 中の溶液に、デス・マーチン・ペルヨージナン (18.6 mmol, 8.15 g) を 0 で添加した。反応混合物を 2 時間、0 ~ 10 の温度で撹拌し、飽和水性 NaHCO_3 で失活させた。有機相を分離し、チオ硫酸ナトリウム溶液および塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、減圧下で濃縮した。この残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、5 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - 2 H - イソキノリン - 1, 4 - ジオン (3.08 g) を、白色の固体として得た：LC - MS (方法 G) UV 検出：220 nm、 $R_t = 0.68$ ；MS：(M + 1) = 208； ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) ppm 1.53 (s, 6H) 2.5 (br. d, 1H) 4.7 (d, 1H) 6.52 (br. s, 1H) 7.38 - 7.43 (m, 1H) 7.72 - 7.8 (m, 1H) 8.10 (d, 1H)。

30

【0303】

ステップ 2：1 - クロロ - 5 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オンの調製

ジメチルホルムアミド (1.0 mL, 13.5 mmol) のジクロロメタン (25 mL) 中の溶液に、室温で、塩化オキサリル (1.2 mL, 13.5 mmol) を 30 分間かけて滴下した。白色の懸濁液を、同じ温度で 1 時間、ガスの発生が停止するまで激しく撹拌した。次いで、5 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - 2 H - イソキノリン - 1, 4 - ジオン (2.0 g, 9.65 mmol) のジクロロメタン (25 mL) 中の溶液を滴下し、混合物を室温で 1 時間撹拌した。反応混合物を氷冷した NaHCO_3 飽和水溶液およびペンタンに注ぎ入れ、有機相を分離した。次いで、水性相をペンタンで抽出し、組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、濃縮して、1 - クロロ - 5 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オン (2.05 g) を、黄色の固体として得た：LC - MS (方法 G)、 $R_t = 0.91$ 、UV 検出：220 nm；MS：(M + 1) = 226 - 228； ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) ppm

40

50

1.52 (s, 6H) 7.36 - 7.44 (m, 1H) 7.77 - 7.81 (m, 2H)

【0304】

ステップ3：5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 1 - (2 - トリメチルシリルエチニル) イソキノリン - 4 - オンの調製。

1 - クロロ - 5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オン (2.04 g、9.0 mmol) のトリエチルアミン (18 mL) 中の溶液に、室温で、CuI (174 mg、0.90 mmol)、ビス - トリフェニルホスフィンパラジウム (II) ジクロリド (0.32 g、0.45 mmol) を添加し、続いて、エチニルトリメチルシラン (1.9 mL、13.6 mmol) を滴下した。黒色の溶液を室温で1時間攪拌した。反応混合物を飽和水性NH₄Clで失活させ、酢酸エチルで2回抽出した。有機相を塩水で洗浄し、無水Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。フラッシュクロマトグラフィによる精製で、5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 1 - (2 - トリメチルシリルエチニル) イソキノリン - 4 - オン (2.25 g) を、黄色の固体として得た：LC - MS (方法 G)、Rt = 1.16、UV検出：220 nm；MS：(M + 1) = 288；¹H NMR (400 MHz、クロロホルム - d) ppm 0.30 (s, 9H) 1.51 (s, 6H) 7.29 - 7.34 (m, 1H) 7.75 - 7.81 (m, 2H)。¹⁹F (400 MHz、クロロホルム - d) ppm - 108。

10

【0305】

ステップ4：1 - エチニル - 5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オンの調製。

5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 1 - (2 - トリメチルシリルエチニル) イソキノリン - 4 - オン (2.25 g、7.8 mmol) のジクロロメタン (31 mL) 中の溶液に、室温で、フッ化カリウム (2.2 当量、1.0 g、17.2 mmol) および18 - クラウン - 6 (2.09 g、7.8 mmol) を添加した。反応混合物を室温で30分間攪拌し、飽和水性NaHCO₃で失活させ、ジクロロメタンで2回抽出した。組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、無水Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。フラッシュクロマトグラフィによる精製で、1 - エチニル - 5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オン (1.46 g) を、黄色の固体として得た：LC - MS (方法 G)、Rt = 0.83、UV検出：220 nm；MS：(M + 1) = 216；¹H NMR (400 MHz、クロロホルム - d) ppm 1.50 (s, 6H) 3.28 (s, 1H) 7.32 - 7.37 (m, 1H) 7.75 - 7.83 (m, 2H)。

20

30

【0306】

ステップ5：1 - (6 , 7 - ジメチルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 3 - イル) - 5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オンの調製。

2 , 3 - ジメチルピリジン - 1 - イウム - 1 - アミン 2 , 4 , 6 - トリメチルベンゼン スルホネート (1.0 g、3.1 mmol) のジメチルホルムアミド (16 mL) 中の溶液に、先ず炭酸カリウム (650 mg、4.6 mmol) を添加し、続いて、ジメチルホルムアミド (6 mL) 中に溶解した1 - エチニル - 5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オン (1.0 g、4.65 mmol) を、30分間かけて滴下した。得られた茶色の混合物を室温で16時間、1 - エチニル - 5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オン出発材料が消失するまで攪拌した。反応混合物を水で失活させ、酢酸エチルで2回抽出した。組み合わせた有機相を水および塩水で洗浄し、無水Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。フラッシュクロマトグラフィによる精製で、1 - (6 , 7 - ジメチルピラゾロ [1 , 5 - a] ピリジン - 3 - イル) - 5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オン (380 mg) を、茶色の固体として得た：mp = 139 ~ 141、LC - MS (方法 G)、Rt = 0.95、UV検出：220 nm；MS：(M + 1) = 336；¹H NMR (400 MHz、クロロホルム - d) ppm 1.54 (s, 6H) 2.38 (s, 3H) 2.75 (s, 3H) 7.15 (d, 1H) 7.32 (t, 1H) 7.58 (d, 1H) 7.68 - 7.71 (m, 1H) 7.

40

50

7.8 (d, 1H) 8.16 (s, 1H). ¹⁹F NMR (400 MHz, クロロホルム-d) ppm -112.

【0307】

ステップ6: 1-(6,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-4,4,5-トリフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリンの調製。

1-(6,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-5-フルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オン(360mg、1.1mmol)の2,2-ジフルオロ-1,3-ジメチルイミダゾリジン(1.7ml)中の溶液を、105℃で24時間攪拌した。反応混合物を室温に冷却し、ジクロロメタンで希釈し、次いで、氷冷NaHCO₃飽和水溶液をゆっくりと添加することにより失活させた。2つの相を分離し、水性相をDCMで抽出した。組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。この残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、1-(6,7-ジメチルピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-4,4,5-トリフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン(310mg)を、ベージュ色の固体として得た: mp = 185 ~ 187℃、LC-MS(方法G)UV検出: 220nm、Rt = 1.14、MS: (M+1) = 358; ¹H NMR (400 MHz, クロロホルム-d)

ppm 1.45 (s, 6H) 2.40 (s, 3H) 2.78 (s, 3H) 7.17 (d, 1H) 7.31 (t, 1H) 7.51 - 7.60 (m, 2H) 7.90 (d, 1H) 8.15 (s, 1H). ¹⁹F NMR (400 MHz, クロロホルム-d) ppm -110, -113.

【0308】

以下の表は、上記の合成技術を用いて調製した式(I)の化合物に係る分析データを示す。

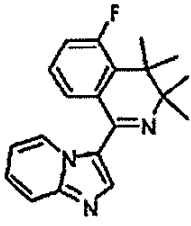
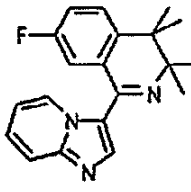
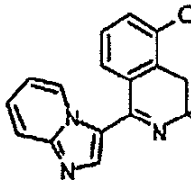
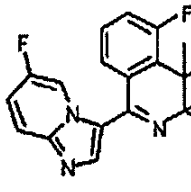
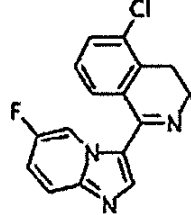
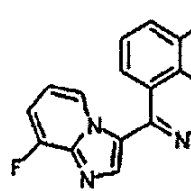
【0309】

10

20

【表 6 - 1】

表 E:式(I)の化合物の物理データ

No.	化合物名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
E-1	5-フルオロ-1-イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル -3,3,4,4-テトラメチル-イ ソキノリン		0.91	322	G	129 - 130
E-2	7-フルオロ-1-イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル -3,3,4,4-テトラメチル-イ ソキノリン		0.89	322	G	
E-3	5-クロロ-1-イミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル -3,3-ジメチル-4H-イソキノ リン		0.92	310	G	
E-4	5-フルオロ-1-(6-フルオロ イミダゾ[1,2-a]ピリジン -3-イル)-3,3,4,4-テト ラメチル-イソキノリン		1.13	340	G	200 - 202
E-5	5-クロロ-1-(6-フルオロ イミダゾ[1,2-a]ピリジン -3-イル)-3,3-ジメチル -4H-イソキノリン		1.11	328	G	142 - 143
E-6	5-フルオロ-1-(8-フルオロ イミダゾ[1,2-a]ピリジン -3-イル)-3,3,4,4-テト ラメチル-イソキノリン		1.10	340	G	156 - 157

10

20

30

40

【表 6 - 2】

No.	化合物名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
E-7	1-[8-(ジフルオロメトキシ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-イソキノリン		1.15	388	G	121 - 122
E-8	1-(8-ブロモイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-イソキノリン		1.15	402	G	
E-9	5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-1-(8-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イソキノリン		0.95	336	G	160 - 161
E-10	5-フルオロ-1-(8-フルオロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン		0.99	312	G	
E-11	5-クロロ-1-(8-フルオロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン		1.09	328	G	122 - 123
E-12	4-ブロモ-5-クロロ-1-(8-フルオロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン		1.12	408	G	213 - 214
E-13	4-ブロモ-5-フルオロ-1-(8-フルオロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン		1.06	392	G	211 - 212

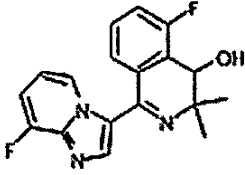
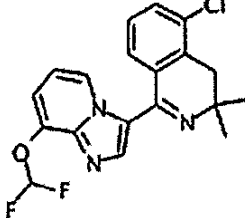
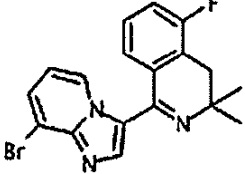
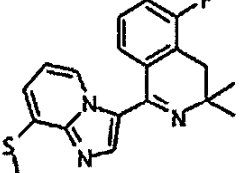
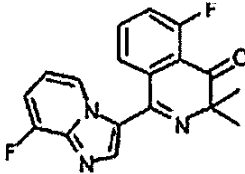
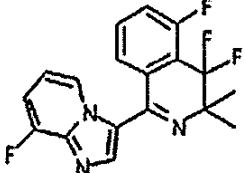
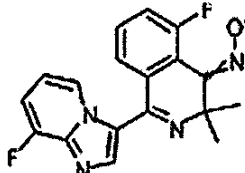
10

20

30

40

【表 6 - 3】

No.	化合物名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
E-14	5-フルオロ-1-(8-フルオロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン-4-オール		0.77	328	G	219 - 219
E-15	5-クロロ-1-[8-(ジフルオロメトキシ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン		1.14	376	G	114 - 115
E-16	1-(8-ブロモイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-5-フルオロ-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン		374	1.05	G	179 - 181
E-17	5-フルオロ-3,3-ジメチル-1-(8-メチルスルファニルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-4H-イソキノリン		340	0.96	G	119 - 120
E-18	5-フルオロ-1-(8-フルオロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オン		0.90	326	G	160 - 161
E-19	4,4,5-トリフルオロ-1-(8-フルオロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-イソキノリン		1.06	348	G	145 - 146
E-20	5-フルオロ-1-(8-フルオロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-N-メトキシ-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-イミン		1.08	355	G	

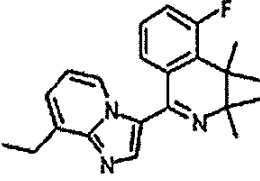
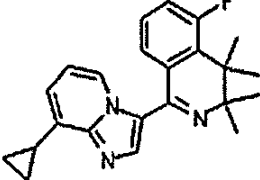
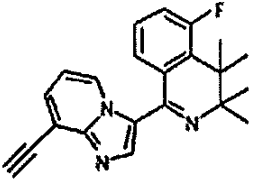
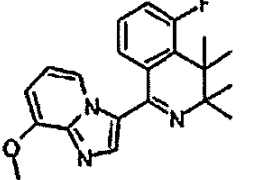
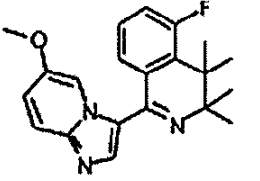
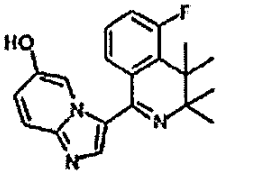
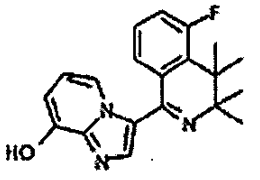
10

20

30

40

【表 6 - 4】

No.	化合物名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
E-21	1-(8-エチルイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル)-5-フルオロ-3,3,4,4- テトラメチル-イソキノリ ン		1.02	350	G	
E-22	1-(8-シクロプロピルイミ ダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-5-フルオロ-3,3,4,4- テトラメチル-イソキノリ ン		1.03	362	G	
E-23	1-(8-エチニルイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル)-5-フルオロ-3,3,4,4- テトラメチル-イソキノリ ン		1.06	346	G	169 - 170
E-24	5-フルオロ-1-(8-メトキ シイミダゾ[1,2-a]ピリジ ン-3-イル)-3,3,4,4-テ トラメチル-イソキノリ ン		0.92	352	G	130 - 130
E-25	5-フルオロ-1-(6-メトキ シイミダゾ[1,2-a]ピリジ ン-3-イル)-3,3,4,4-テ トラメチル-イソキノリ ン		1.05	352	G	214 - 215
E-26	3-(5-フルオロ-3,3,4,4-テ トラメチル-1-イソキノリ ル)イミダゾ[1,2-a]ピリ ジン-6-オール		0.85	338	G	321 - 322
E-27	3-(5-フルオロ-3,3,4,4-テ トラメチル-1-イソキノリ ル)イミダゾ[1,2-a]ピリ ジン-8-オール		0.91	338	G	271 - 272

10

20

30

40

【表 6 - 5】

No.	化合物名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
E-28	5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-1-(8-プロパ-2-イノキシイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イソキノリン		1.01	376	G	
E-29	5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-1-[8-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル]イソキノリン		1.22	390	G	141 - 142
E-30	5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-1-(5-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イソキノリン		0.87	336	G	139 - 140
E-31	5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-1-(7-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イソキノリン		1.02	336	G	
E-32	1-(8-クロロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-イソキノリン		1.14	356	G	167 - 168
E-33	3,3,4,4-テトラメチル-1-(8-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イソキノリン		0.88	318	G	
E-34	4-ブロモ-1-(8-ブロモイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-5-フルオロ-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン		1.11	452	G	217 - 218

10

20

30

40

【表 6 - 6】

No.	化合物名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
E-35	1-(8-ブロモイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル)-5-フルオロ-3,3-ジメ チル-4H-イソキノリン -4-オール		0.83	390	G	204 - 205
E-36	1-(8-ブロモイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル)-5-フルオロ-3,3-ジメ チル-イソキノリン-4-オン		0.95	388	G	146 - 147
E-37	1-(8-ブロモイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル)-4,4,5-トリフルオロ -3,3-ジメチル-イソキノ リン		1.10	309	G	209 - 210
E-38	3-(5-フルオロ-3,3,4,4-テ トラメチル-1-イソキノリ ル)イミダゾ[1,2-a]ピリ ジン-8-カルボニトリル		1.12	437	G	212 - 213
E-39	4,4,5-トリフルオロ-3,3- ジメチル-1-(8-メチルイ ミダゾ[1,2-a]ピリジン-3- イル)イソキノリン		0.99	344	G	
E-40	1-(2,8-ジメチルイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル)-5-フルオロ-3,3,4,4- テトラメチル-イソキノリ ン		0.93	350	G	
E-41	1-(8-ブロモイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-4H-イ ソキノリン		0.84	356	G	132 - 133
E-42	1-(8-ブロモイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-イソキ ノリン-4-オン		0.96	370	G	204 - 205

10

20

30

40

【表 6 - 7】

No.	化合物名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
E-43	1-(8-ブロモイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル)-4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン		1.11	392	G	173 - 173
E-44	5-フルオロ-1-(7-ヨード イミダゾ[1,2-a]ピリジン -3-イル)-3,3,4,4-テトラ メチル-イソキノリン		1.21	448	G	
E-45	4,4-ジフルオロ-3,3-ジメ チル-1-(8-メチルイミダ ゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イソキノリン		0.95	326	G	
E-46	3-(5-フルオロ-3,3,4,4-テ トラメチル-1-イソキノリ ル)イミダゾ[1,2-a]ピリ ジン-7-カルボニトリル		1.12	347	G	193 - 194
E-47	1-(8-クロロ-7-メチル-イ ミダゾ[1,2-a]ピリジン-3- イル)-5-フルオロ-3,3,4,4- テトラメチル-イソキノ リン		1.14	370	G	185 - 186
E-48	5-フルオロ-1-(7-メトキ シイミダゾ[1,2-a]ピリジ ン-3-イル)-3,3,4,4-テ トラメチル-イソキノリン		0.99	352	G	139 - 140
E-49	3-(5-フルオロ-3,3,4,4-テ トラメチル-1-イソキノリ ル)イミダゾ[1,2-a]ピリ ジン-7-オール		0.88	338	G	246 - 247

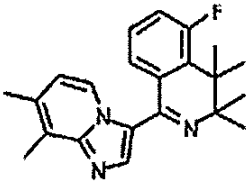
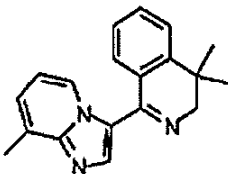
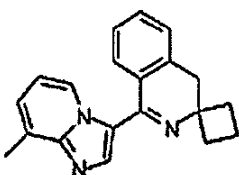
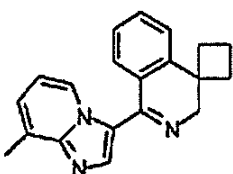
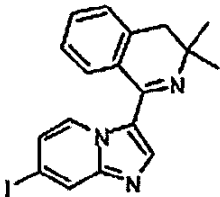
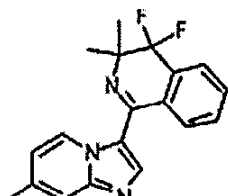
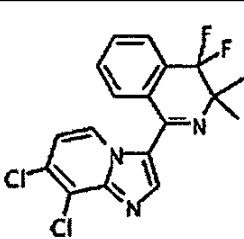
10

20

30

40

【表 6 - 8】

No.	化合物名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
E-50	1-(7,8-ジメチルイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル)-5-フルオロ-3,3,4,4- テトラメチル-イソキノリ ン		0.91	350	G	185 - 186
E-51	4,4-ジメチル-1-(8-メチ ルイミダゾ[1,2-a]ピリジ ン-3-イル)-3H-イソキノ リン		0.73	290	G	
E-52	1-(8-メチルイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル) スピロ[4H-イソキノリン -3,1'-シクロブタン]		0.80	302	G	
E-53	1-(8-メチルイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル) スピロ[3H-イソキノリン -4,1'-シクロブタン]		1.14	302	G	127 - 129
E-54	1-(7-ヨードイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-4H-イ ソキノリン		1.57	402.1	H	190- 193
E-55	4,4-ジフルオロ-3,3-ジメ チル-1-(7-メチルイミダ ゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イソキノリン		1.26	326.3	H	
E-56	1-(7,8-ジクロロイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル)-4,4-ジフルオロ-3,3- ジメチル-イソキノリン		1.19	381	G	>210

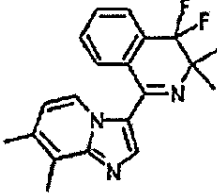
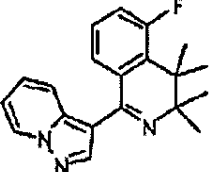
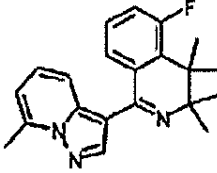
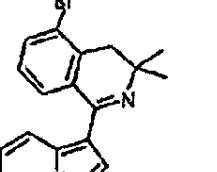
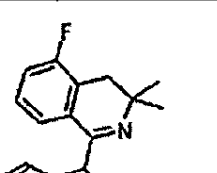
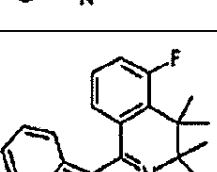
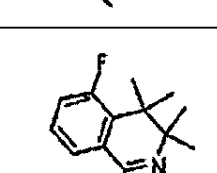
10

20

30

40

【表 6 - 9】

No.	化合物名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
E-57	1-(7,8-ジメチルイミダゾ [1,2-a]ピリジン-3-イル)-4,4-ジフルオロ-3,3- ジメチル-イソキノリン		0.88	340	G	159 - 161
E-58	5-フルオロ-3,3,4,4-テト ラメチル-1-ピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-イル- イソキノリン		0.74	322	G	124 - 126
E-59	5-フルオロ-3,3,4,4-テト ラメチル-1-(7-メチルピ ラゾロ[1,5-a]ピリジン-3- イル)イソキノリン		0.81	336	G	134 - 136
E-60	5-ブロモ-3,3-ジメチル -1-ピラゾロ[1,5-a]ピリジ ン-3-イル-4H-イソキノ リン		0.78	354-35 6	G	
E-61	5-フルオロ-3,3-ジメチル -1-ピラゾロ[1,5-a]ピリジ ン-3-イル-4H-イソキノ リン		0.67	294	G	
E-62	5-フルオロ-3,3,4,4-テト ラメチル-1-(2-メチルピ ラゾロ[1,5-a]ピリジン-3- イル)イソキノリン		0.77	335	G	
E-63	1-(6,7-ジメチルピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-イル)-5-フルオロ-3,3,4,4- テトラメチル-イソキノリン		0.88	350	G	175 - 176

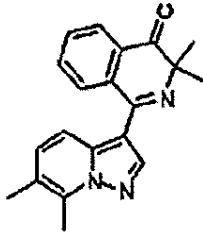
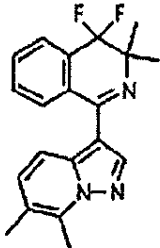
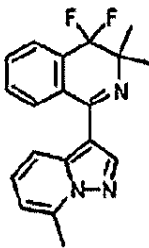
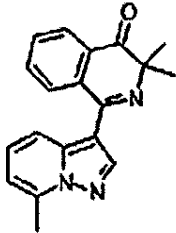
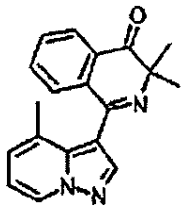
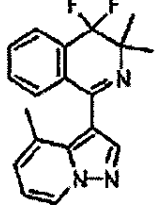
10

20

30

40

【表 6 - 10】

No.	化合物名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
E-64	1-(6,7-ジメチルピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オン		0.86	318	G	152 - 153
E-65	1-(6,7-ジメチルピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-イル)-4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン		1.03	340	G	160 - 161
E-66	4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-1-(7-メチルピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-イル)イソキノリン		0.97	326	G	105 - 107
E-67	3,3-ジメチル-1-(7-メチルピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-イル)イソキノリン-4-オン		0.77	304	G	110 - 112
E-68	3,3-ジメチル-1-(4-メチルピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-イル)イソキノリン-4-オン		0.83	304	G	140 - 141
E-69	4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-1-(4-メチルピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-イル)イソキノリン		0.99	326	G	113 - 114

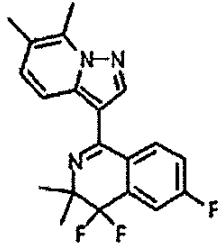
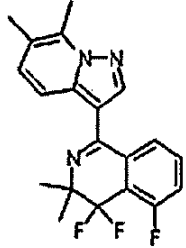
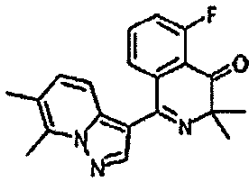
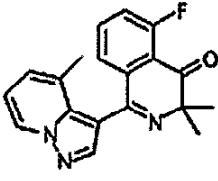
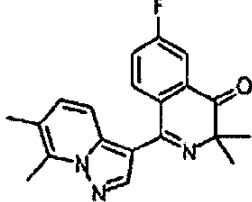
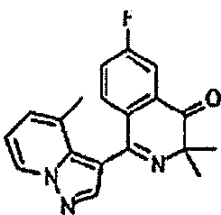
10

20

30

40

【表 6 - 1 1】

No.	化合物名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
E-70	1-(6,7-ジメチルピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-イル)-4,4,6-トリフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン		1.09	358	G	183 - 185
E-71	1-(6,7-ジメチルピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-イル)-4,4,5-トリフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン		1.14	358	G	185 - 187
E-72	1-(6,7-ジメチルピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-イル)-5-フルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オン		0.95	336	G	139 - 141
E-73	5-フルオロ-3,3-ジメチル-1-(4-メチルピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-イル)イソキノリン-4-オン		0.89	322	G	141 - 143
E-74	1-(6,7-ジメチルピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-イル)-6-フルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オン		0.92	336	G	168 - 170
E-75	6-フルオロ-3,3-ジメチル-1-(4-メチルピラゾロ [1,5-a]ピリジン-3-イル)イソキノリン-4-オン		0.89	322	G	180 - 183

10

20

30

40

【表 6 - 1 2】

No.	化合物名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
E-78	1-(6-ブロモ-7-メチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オン		1.13	382-384	G	166 - 168
E-79	1-(6-ブロモ-7-メチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン		1.34	404-406	G	180 - 182
E-80	4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-1-ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル-イソキノリン		0.97	312	G	78 - 82
E-81	1-(6-ブロモピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン		1.17	390-392	G	127 - 129
E-82	1-(6-ブロモピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オン		0.96	368-370	G	147 - 149
E-83	4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-1-(6-メチルピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)イソキノリン		0.96	326	G	105 - 107
E-84	1-(4-ブロモピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オン		0.85	368-370	G	148 - 151

10

20

30

40

【表 6 - 1 3】

No.	化合物名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
E-85	3-(4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-1-イソキノリル)ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-6-カルボニトリル		1.06	337	G	191 - 194
E-86	1-(6-エチルピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン		1.04	340	G	
E-87	1-(6-クロロピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン		1.16	346-348	G	113 - 118
E-88	4,4-ジフルオロ-1-(6-フルオロ-7-メチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-イソキノリン		1.13	344	G	115 - 118
E-89	4,4-ジフルオロ-1-(4-フルオロピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-イソキノリン		0.89	330	G	
E-90	1-(6-エチニルピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン		1.10	336	G	145 - 147
E-91	1-(6-クロロ-7-メチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン		1.23	360-362	G	166 - 168

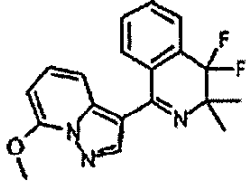
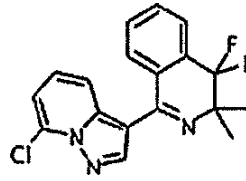
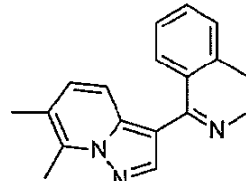
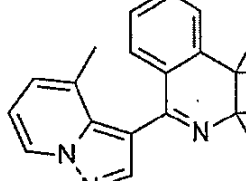
10

20

30

40

【表 6 - 1 4】

No.	化合物名	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C
E-92	4,4-ジフルオロ-1-(7-メトキシピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-3,3-ジメチル-イソキノリン		0.87	342	G	120 - 124
E-93	1-(7-クロロピラゾロ[1,5-a]ピリジン-3-イル)-4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン		1.11	346-348	G	129 - 132
E-94			0.82	328	G	124 - 126
E-95			0.77	314	G	

【0310】

生物学的実施例

ボトリオチニアフッケリアナ (*Botryotinia fuckeliana*) (ボトリチス シネレア (*Botrytis cinerea*)) / 液体培養 (灰色カビ病)

極低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地 (Vogel's 液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 3 ~ 4 日後に、成長の阻害を測光法により測定する。

【0311】

以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比較して、20 ppm で、ボトリオチニアフッケリアナ (*Botryotinia fuckeliana*) の少なくとも 80 % 防除をもたらした：

E - 1、E - 6、E - 7、E - 8、E - 9、E - 10、E - 11、E - 19、E - 21、E - 22、E - 23、E - 24、E - 27、E - 29、E - 30、E - 31、E - 32、E - 33、E - 38、E - 39、E - 40、E - 44、E - 45、E - 46、E - 47、E - 48、E - 49、E - 50、E - 51、E - 52、E - 53、E - 55、E - 56、E - 57、E - 58、E - 59、E - 60、E - 62、E - 63、E - 64、E - 65、E - 66、E - 67、E - 68、E - 69、E - 70、E - 71、E - 72、E - 74、E - 75、E - 76、E - 77、E - 78、E - 79、E - 80、E - 81、E - 82、E - 83、E - 85、E - 86、E - 87、E - 88、E - 89、E - 91、E - 92、E - 93、E - 95、E - 95。

【0312】

10

20

30

40

50

グロメレラゲナリウム (*Glomerella lagenarium*) (コレトリカムラゲナリウム (*Colletotrichum lagenarium*)) / 液体培養 (炭疽病)

極低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地 (PDB ジャガイモブドウ糖液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 3 ~ 4 日後に、成長の阻害を測光法により計測する。

【0313】

以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比較して、20 ppm で、グロメレラゲナリウム (*Glomerella lagenarium*) の少なくとも 80% 防除をもたらした：

E - 1、E - 2、E - 3、E - 6、E - 7、E - 8、E - 9、E - 10、E - 11、E - 14、E - 16、E - 17、E - 19、E - 21、E - 22、E - 24、E - 27、E - 29、E - 30、E - 31、E - 32、E - 33、E - 37、E - 38、E - 39、E - 40、E - 44、E - 45、E - 46、E - 47、E - 48、E - 49、E - 50、E - 52、E - 55、E - 57、E - 58、E - 59、E - 62、E - 63、E - 64、E - 65、E - 66、E - 67、E - 69、E - 70、E - 71、E - 72、E - 74、E - 76、E - 77、E - 78、E - 79、E - 80、E - 81、E - 82、E - 83、E - 86、E - 87、E - 88、E - 89、E - 90、E - 91、E - 92、E - 93、E - 94、E - 95。

【0314】

フザリウムクルモルム (*Fusarium culmorum*) / 液体培養 (胴枯れ病)

極低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地 (PDB ジャガイモブドウ糖液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 3 ~ 4 日後に、成長の阻害を測光法により測定する。

【0315】

以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比較して、20 ppm で、フザリウムクルモルム (*Fusarium culmorum*) の少なくとも 80% 防除をもたらした：

E - 1、E - 6、E - 8、E - 9、E - 21、E - 31、E - 32、E - 33、E - 39、E - 44、E - 45、E - 47、E - 50、E - 55、E - 57、E - 59、E - 63、E - 64、E - 65、E - 66、E - 67、E - 69、E - 70、E - 71、E - 72、E - 74、E - 76、E - 78、E - 79、E - 80、E - 81、E - 82、E - 83、E - 86、E - 87、E - 88、E - 89、E - 91、E - 92、E - 93、E - 94。

【0316】

ゲーウマノミセス グラミニス (*Gaeumannomyces graminis*) / 液体培養 (穀類の立枯病)

極低温保管しておいた真菌の菌糸体断片を栄養液体培地 (PDB ジャガイモブドウ糖液体培地) に直接混合した。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 4 ~ 5 日後に、成長の阻害を測光法により測定する。

【0317】

以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比較して、20 ppm で、ゲーウマノミセス グラミニス (*Gaeumannomyces graminis*) の少なくとも 80% 防除をもたらした：

10

20

30

40

50

E - 1、E - 6、E - 9、E - 25、E - 37、E - 38、E - 39、E - 41、E - 58、E - 63、E - 64、E - 65、E - 66、E - 69、E - 71、E - 76、E - 79、E - 80、E - 81、E - 82、E - 83、E - 86、E - 87、E - 88、E - 90、E - 91、E - 92、E - 94。

【0318】

モノグラフェラニバリス (*Monographella nivalis*) (コムギ赤かび病菌 (*Microdochium nivale*)) / 液体培養 (穀類の根腐れ病)

極低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地 (PDB ジャガイモブドウ糖液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 4 ~ 5 日後に、成長の阻害を測光法により測定する。

10

【0319】

以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比して、20 ppm で、モノグラフェラニバリス (*Monographella nivalis*) の少なくとも 80 % 防除をもたらした：

E - 6、E - 9、E - 15、E - 21、E - 22、E - 24、E - 29、E - 33、E - 38、E - 39、E - 44、E - 45、E - 52、E - 53、E - 57、E - 59、E - 64、E - 65、E - 66、E - 67、E - 69、E - 70、E - 71、E - 72、E - 76、E - 78、E - 80、E - 81、E - 82、E - 83、E - 88、E - 89、E - 90、E - 91、E - 92、E - 93、E - 94。

20

【0320】

コムギ葉枯病菌 (*Mycosphaerella graminicola*) (セプトリア トリティシ (*Septoria tritici*)) / 液体培養 (葉枯病)

極低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地 (PDB ジャガイモブドウ糖液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 4 ~ 5 日後に、成長の阻害を測光法により測定する。

30

【0321】

以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比して、20 ppm で、コムギ葉枯病菌 (*Mycosphaerella graminicola*) の少なくとも 80 % 防除をもたらした：

E - 22、E - 39、E - 44、E - 80、E - 81、E - 82、E - 83、E - 86、E - 87、E - 88、E - 93。

【0322】

マグナポルテ グリセア (*Magnaporthe oryzae*) (イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*)) / イネ / 葉片予防 (稲熱病)

イネの葉切片 (cv. Ballila) をマルチウェルプレート (24 ウェル型) 中の寒天の上に載せ、水で希釈した配合したテスト化合物を噴霧する。適用から 2 日後に、葉切片に真菌の胞子懸濁液を播種する。気候キャビネット中において、24 時間の暗闇、これに続く、12 時間の光 / 12 時間の暗闇の光環境下、22 および 80 % の相対湿度で播種した葉切片をインキュベートし、化合物の活性を、未処理の検査用の葉切片に適切なレベルの病害による損傷が現れた時点で (適用から 5 ~ 7 日間)、未処理のものとは比した病害防除割合として評価する。

40

【0323】

以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比して、200 ppm で、マグナポルテ グリセア (*Magnaporthe oryzae*) の少なくとも 50 % 防除をもたらした：

E - 6、E - 8、E - 9、E - 31、E - 33、E - 39、E - 45、E - 57、E - 5

50

9、E-63、E-66、E-69、E-70、E-71、E-81、E-83、E-86、E-87、E-88、E-91、E-92、E-93、E-94、E-95。

【0324】

マグナポルテ グリセア (*Magnaporthe oryzae*) (イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*)) / 液体培養 (稲熱病)

極低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地 (PDB ジャガイモブドウ糖液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 3 ~ 4 日後に、成長の阻害を測光法により測定する。以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比して、60 ppm で、マグナポルテ グリセア (*Magnaporthe oryzae*) の少なくとも 80% 防除をもたらした：

E-50、E-51、E-52、E-53、E-55、E-56、E-57、E-63、E-64、E-65、E-66、E-67、E-69、E-70、E-71、E-72、E-74、E-76、E-77、E-78、E-79、E-80、E-81、E-82、E-83、E-85、E-86、E-87、E-88、E-89、E-90、E-91、E-92、E-93、E-94、E-95。

【0325】

スクレロティニア スクレロティオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*) / 液体培養 (菌核病 (*cottony rot*))

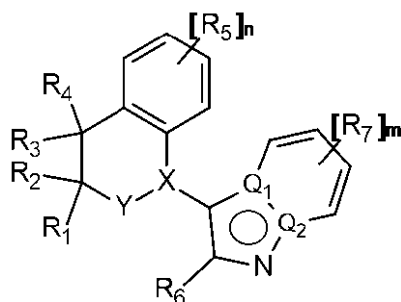
新たに増殖させた液体培養の真菌の菌糸体断片を、栄養液体培地 (Vogel's 液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、真菌性物質を含有する栄養液体培地を添加する。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 3 ~ 4 日後に、成長の阻害を測光法により測定する。以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比して、20 ppm で、スクレロティニア スクレロティオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*) の少なくとも 80% 防除をもたらした：

E-50、E-51、E-52、E-55、E-57、E-64、E-65、E-66、E-67、E-69、E-70、E-71、E-72、E-79、E-80、E-81、E-82、E-83、E-86、E-87、E-88、E-89、E-91、E-93。

本発明のまた別の態様は、以下のとおりであってもよい。

〔1〕式 (I)：

【化 5 1】



(I)

(式中、

Q₁は窒素原子であり、および、Q₂は炭素原子であるか；または

Q₁は炭素原子であり、および、Q₂は窒素原子であり；

Y-Xは、G₁、G₂、G₃、およびG₄から選択されるラジカルを表し；

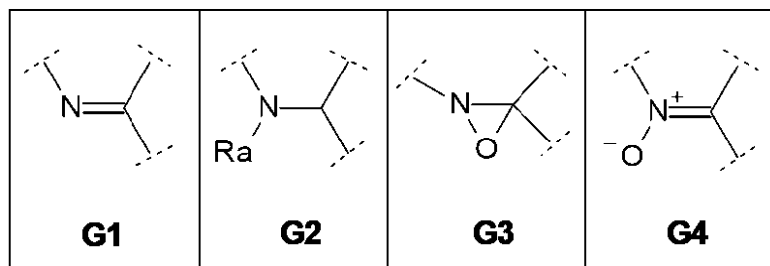
10

20

30

40

【化52】



R_1 および R_2 は各々、水素、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、および $C_2 \sim C_6$ アルキニルから独立して選択され、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、およびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよい；または

R_1 および R_2 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル基（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよい）を表し；

R_3 および R_4 は各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、および $C_2 \sim C_6$ アルキニルから独立して選択され、ここで、前記アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アルケニル、およびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよい；または

R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ 、 $C=NOR_a$ 、 $C=C(R_b)(R_c)$ 、または $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよい）を表し；式中、 R_b および R_c は各々、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択され、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、およびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよく、かつ、 R_a は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、および $C_3 \sim C_6$ アルキニルから選択され、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、およびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよく；あるいは

R_2 および R_3 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよく、さらに、環炭素単位は、酸素または硫黄原子により置き換えられてもよい）を表し；

各 R_5 は独立して、ハロゲン、ヒドロキシル、メルカプト、ニトロ、シアノ、ホルミル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $-C(=NOR_a)C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、アリール、ヘテロアリール、アリールオキシ、またはヘテロアリールオキシを表し、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アリール、およびヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、シアノ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～5個の置換基で任意に置換されてもよく； n は、0、1、2、3、または4であり；

R_6 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、またはヒドロキシ

10

20

30

40

50

ルであり；

各 R_7 は独立して、ヒドロキシル、メルカプト、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、または $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシを表し； m は、0、1、2、3 または 4 であり；

R_a は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、およびフェノキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよい）の化合物、または、その塩もしくは N - オキッド。

10

〔2〕 R_1 および R_2 が各々、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、前記アルキルおよびシクロアルキル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよい；または、

R_1 および R_2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよい）を表す、前記〔1〕に記載の化合物。

〔3〕 R_3 および R_4 が各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、前記アルキル、アルコキシ、およびシクロアルキル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよい；または、 R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C = O$ 、 $C = NOR_d$ 、 $C = C(R_b)(R_c)$ または $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよい）を表し、式中、 R_b および R_c は各々、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択され、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、およびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよく、 R_d は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、および $C_3 \sim C_6$ アルキニルから選択され、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、およびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよく；あるいは、 R_2 および R_3 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよく、さらに、環炭素単位は、酸素または硫黄原子により置き換えられてもよい）を表す、前記〔1〕または〔2〕に記載の化合物。

20

30

40

〔4〕各 R_5 が独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $-C(=NOR_a)C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、ヘテロアリール（ここで、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリル、またはオキサゾリルである）、フェノキシ、またはヘテロアリールオキシ（ここで、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリル、またはオキサゾリルである）を表し、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、フェニル、およびヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、シアノ、および $C_1 \sim C_6$ アルキルチ

50

オから独立して選択される 1 ~ 5 個の置換基で任意に置換されてもよく； n が、0、1、2、3、または4である、前記〔1〕、〔2〕、または〔3〕のいずれか一項に記載の化合物。

〔5〕 R_6 が、水素、ハロゲン、または $C_1 \sim C_2$ アルキルである、前記〔1〕、〔2〕、〔3〕、または〔4〕のいずれか一項に記載の化合物。

〔6〕各 R_7 が独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、または $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシであり； m が、0、1、2、3、または4である、前記〔1〕、〔2〕、〔3〕、〔4〕、または5のいずれか一項に記載の化合物。

〔7〕 $Y - X$ が、 G_1 を表す、前記〔1〕、〔2〕、〔3〕、〔4〕、5、または6のいずれか一項に記載の化合物。

〔8〕 $Y - X$ が、前記ラジカル G_1 を表し； R_1 および R_2 が各々、独立して、水素または $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり、ここで、前記アルキル基は、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよい；または、 R^1 および R^2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル基を表し； R_3 および R_4 が各々、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、および $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、前記アルキルおよびシクロアルキル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_3$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよい；または、 R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C = O$ 、 $C = NOR_d$ 、または $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_3$ アルキルチオからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよい）を表し、式中、 R_d は、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、および $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルから選択され、ここで、前記アルキルおよびシクロアルキル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ（好ましくは、 R_d は、水素および $C_1 \sim C_3$ アルキルから選択され、ここで、前記アルキル基は、1 ~ 3 個のハロゲン原子（好ましくはフッ素原子）で任意に置換されてもよい）から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよく；各 R_5 が独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、フェニル、ヘテロアリール（ここで、ヘテロアリールは、ピリジル、チアゾリル、またはオキサゾリルである）を表し、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、フェニル、およびヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、および $C_1 \sim C_3$ アルコキシから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよく； n が、0、1、または2であり； R_6 が、水素、フルオロ、クロロ、またはメチルであり；各 R_7 が独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、または $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し； m が、0、1、または2である、前記〔1〕に記載の化合物、または、その塩もしくは $N -$ オキシド。

〔9〕 $Y - X$ が、前記ラジカル G_1 を表し； R_1 および R_2 が各々、独立して、 $C_1 \sim C_3$ アルキルであるか；または、 R_1 および R_2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル基を表し； R_3 および R_4 が各々、水素、ハロゲン、および $C_1 \sim C_4$ アルキルから独立して選択されるか；または、 R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C = O$ または $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し；各 R_5 が独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_3 \sim C_3$ シクロアルキルを表し； n が、0、1、または2であり； R_6 が、水素、フルオロ、クロロ、またはメチルであり；各 R_7 が独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、または $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し； m が、0、1、または2である、前記〔1〕に記載の化合物、または、その塩もしくは $N -$ オキシド。

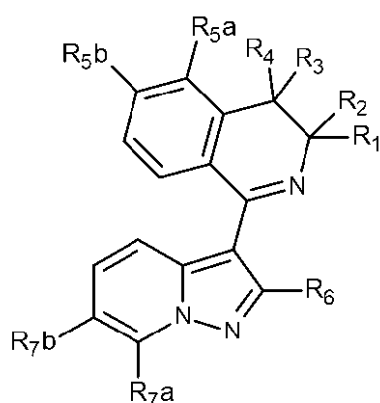
〔10〕 Y - X が、前記ラジカル G 1 を表し； R₁ および R₂ が各々、独立して、C₁ ~ C₂ アルキル基（好ましくは、共にメチル）であり； R₃ および R₄ が各々、水素、フルオロ、および C₁ ~ C₂ アルキル（好ましくは、共にメチルであるか、または、共にフルオロである）から独立して選択されるか；または、R₃ および R₄ が、これらが結合している炭素原子と一緒に、C₃ ~ C₄ シクロアルキルを表し；各 R₅ が独立して、フルオロ、クロロ、プロモ、シアノ、または C₁ ~ C₂ アルキル（好ましくはフルオロ）を表し； n が、0、1、または 2（好ましくは 0 または 1）であり； R₆ が、水素であり；各 R₇ が独立して、フルオロ、クロロ、または C₁ ~ C₃ アルキル（好ましくは、フルオロまたはメチル）を表し； m が、1 または 2 である、前記〔1〕に記載の化合物、または、その塩もしくは N - オキシド。

10

〔11〕 Q₁ が、炭素原子であり、Q₂ が、窒素原子である、前記〔1〕、〔2〕、〔3〕、〔4〕、5、6、7、8、9、または 10 のいずれか一項に記載の化合物。

〔12〕 前記化合物が、式 (IK) :

【化 5 3】



20

(IK)

（式中、R₁ は、メチルであり； R₂ は、メチルであり； R₃ は、メチルまたはフルオロであり； R₄ は、メチルまたはフルオロであり； R_{5a} は、フルオロまたは水素であり； R_{5b} は、フルオロまたは水素であり； R₆ は、水素であり； R_{7a} は、メチルまたは水素であり； R_{7b} は、メチル、フルオロ、または水素であるか；

30

または、式中、R₁ は、メチルであり、R₂ は、メチルであり、R₆ は、水素であり、かつ、R₃、R₄、R_{5a}、R_{5b}、R_{7a}、および R_{7b} は、以下に定義されているとおりである）：

【表 7】

化合物	R ₃	R ₄	R _{5a}	R _{5b}	R _{7a}	R _{7b}
IK-1	メチル	メチル	フルオロ	水素	メチル	メチル
IK-2	フルオロ	フルオロ	フルオロ	水素	メチル	メチル
IK-3	フルオロ	フルオロ	水素	フルオロ	メチル	メチル
IK-4	フルオロ	フルオロ	水素	水素	メチル	メチル
IK-5	フルオロ	フルオロ	水素	水素	メチル	フルオロ
IK-6	フルオロ	フルオロ	水素	水素	メチル	水素
IK-7	フルオロ	フルオロ	水素	水素	水素	メチル
IK-8	メチル	メチル	フルオロ	水素	メチル	水素
IK-9	フルオロ	フルオロ	水素	フルオロ	メチル	水素
IK-10	フルオロ	フルオロ	水素	フルオロ	水素	メチル

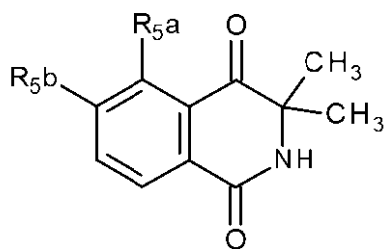
40

50

の化合物である、前記〔1〕に記載の化合物、または、その塩もしくはN - オキシド。

〔13〕式(XA)：

【化54】

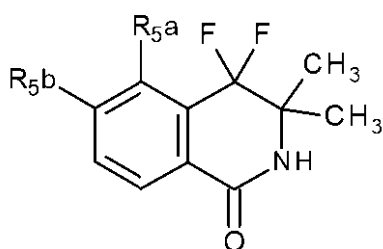


(XA)

10

(式中、R_{5a}は、フルオロまたは水素であり；R_{5b}は、フルオロまたは水素である)の化合物、または、式(XB)：

【化55】

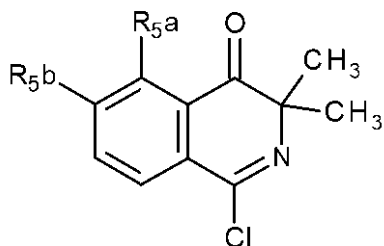


(XB)

20

(式中、R_{5a}は、フルオロまたは水素であり；R_{5b}は、フルオロまたは水素である)の化合物、または、式(XC)：

【化56】

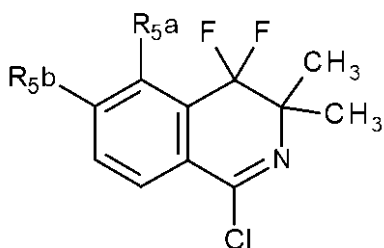


(XC)

30

(式中、R_{5a}は、フルオロまたは水素であり；R_{5b}は、フルオロまたは水素である)の化合物、または、式(XD)：

【化57】



(XD)

40

(式中、R_{5a}は、フルオロまたは水素であり；R_{5b}は、フルオロまたは水素である)の化合物。

〔14〕殺菌・殺カビ的に有効な量の前記〔1〕～〔12〕のいずれかに記載されている式(I)の化合物を含み、任意で希釈剤および/またはさらなる活性成分を含む、組成物。

〔15〕植物病原性病害の駆除、予防、または防除方法であって、植物病原体、植物病原

50

体の生息地、または、植物病原体による被害を受けやすい植物、または、その繁殖体に、殺菌・殺力比的に有効な量の前記〔 1 〕～〔 1 2 〕のいずれかに定義されている式（ I ）の化合物、または、殺菌・殺力比的に有効な量の前記〔 1 〕～〔 1 2 〕のいずれかに定義されている式（ I ）の化合物を含む組成物、または、前記〔 1 4 〕に定義されている組成物を適用する工程を含むことを特徴とする方法。

フロントページの続き

(51)Int.Cl. F I
C 0 7 D 217/24

(74)代理人 100119013

弁理士 山崎 一夫

(74)代理人 100123777

弁理士 市川 さつき

(74)代理人 100111796

弁理士 服部 博信

(74)代理人 100196405

弁理士 小松 邦光

(72)発明者 クアランタ ラウラ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 トラー シュテファン

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 ヴァイス マティアス

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 ボウ ハムダン ファルハン

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

審査官 三上 晶子

(56)参考文献 国際公開第2005/070917(WO, A1)

特開昭62-294679(JP, A)

国際公開第2007/011022(WO, A1)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C 0 7 D 2 0 1 / 0 0 - 5 1 9 / 0 0

A 0 1 N 1 / 0 0 - 6 5 / 4 8

A 0 1 P 1 / 0 0 - 2 3 / 0 0

C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N)