

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第5356383号
(P5356383)

(45) 発行日 平成25年12月4日(2013.12.4)

(24) 登録日 平成25年9月6日(2013.9.6)

(51) Int. Cl.		F I	
C O 7 D 231/14	(2006.01)	C O 7 D 231/14	C S P
C O 7 D 405/12	(2006.01)	C O 7 D 405/12	
C O 7 D 307/56	(2006.01)	C O 7 D 307/56	
A O 1 N 43/56	(2006.01)	A O 1 N 43/56	C
A O 1 N 43/36	(2006.01)	A O 1 N 43/36	A

請求項の数 10 (全 54 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2010-518673 (P2010-518673)	(73) 特許権者	507203353
(86) (22) 出願日	平成20年7月31日(2008.7.31)		バイエル・クroppサイエンス・アーゲー
(65) 公表番号	特表2010-534715 (P2010-534715A)		BAYER CROPSCIENCE A
(43) 公表日	平成22年11月11日(2010.11.11)		G
(86) 国際出願番号	PCT/EP2008/060039		ドイツ国、40789・モンハイム、アル
(87) 国際公開番号	W02009/016220		フレートーノベルーシユトラーセ・50
(87) 国際公開日	平成21年2月5日(2009.2.5)	(74) 代理人	110001173
審査請求日	平成23年3月16日(2011.3.16)		特許業務法人川口国際特許事務所
(31) 優先権主張番号	07356104.5	(74) 代理人	100103920
(32) 優先日	平成19年7月31日(2007.7.31)		弁理士 大崎 勝真
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)	(74) 代理人	100124855
			弁理士 坪倉 道明
		(72) 発明者	デボルド, フィリップ
			フランス国、エフ-69006・リヨン、
			リュ・デュ・ドクトウール・ムイセ・14
			最終頁に続く

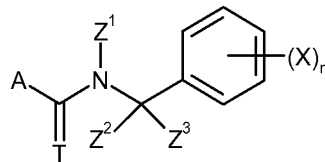
(54) 【発明の名称】 殺真菌性のN-シクロアルキルベンジルチオカルボキサミドまたはN-シクロアルキルベンジル-N'-置換アミジン誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



(I)

[式中、

A は、最大 4 個の R 基で置換されていることができる、炭素に結合した、不飽和もしくは部分飽和の 5 員ヘテロシクリル基を表し、

T は、S を表し、

Z¹ は、置換されていない C₃ - C₇ - シクロアルキル、または(同じもしくは異なっていることができ、ハロゲン原子、シアノ、C₁ - C₈ - アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大 9 個のハロゲン原子を含む C₁ - C₈ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₈ - アルコキシ、同じもしくは異なっていることができる最大 9 個のハロゲン原子を含む C₁ - C₈ - ハロゲノアルコキシ、C₁ - C₈ - アルコキシカルボニル、同じもしく

は異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_8$ -ハロゲノアルコキシカルボニル、 $C_1 - C_8$ -アルキルアミノカルボニル、ジ- $C_1 - C_8$ -アルキルアミノカルボニルからなるリストから選択することができる最大10個の原子もしくは基で置換されている) $C_3 - C_7$ -シクロアルキルを表し、

Z^2 および Z_3 は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、 $C_1 - C_8$ -アルキル、 $C_2 - C_8$ -アルケニル、 $C_2 - C_8$ -アルキニル、シアノ、ニトロ、ハロゲン原子、 $C_1 - C_8$ -アルコキシ、 $C_2 - C_8$ -アルケニルオキシ、 $C_2 - C_8$ -アルキニルオキシ、 $C_3 - C_7$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_8$ -アルキルスルフェニル、アミノ、 $C_1 - C_8$ -アルキルアミノ、ジ- $C_1 - C_8$ -アルキルアミノ、 $C_1 - C_8$ -アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_8$ -アルキルカルバモイル、ジ- $C_1 - C_8$ -アルキルカルバモイル、 $N - C_1 - C_8$ -アルキル- $C_1 - C_8$ -アルコキシカルバモイルを表し、または Z^2 および Z_3 は、これらが結合している炭素原子と一緒に置換されたもしくは置換されていない $C_3 - C_7$ -シクロアルキルを形成していることができ、

X は、同じもしくは異なっていることができ、ハロゲン原子、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、スルファニル、アミノ、ペンタフルオロ-6-スルファニル、 $C_1 - C_8$ -アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_8$ -ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_8$ -アルキルアミノ、ジ- $C_1 - C_8$ -アルキルアミノ、 $C_1 - C_8$ -アルコキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_8$ -ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_8$ -アルコキシ- $C_1 - C_8$ -アルキル、 $C_1 - C_8$ -アルキルスルファニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_8$ -ハロゲノアルキルスルファニル、 $C_2 - C_8$ -アルケニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_2 - C_8$ -ハロゲノアルケニル、 $C_2 - C_8$ -アルキニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_2 - C_8$ -ハロゲノアルキニル、 $C_2 - C_8$ -アルケニルオキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_2 - C_8$ -ハロゲノアルケニルオキシ、 $C_2 - C_8$ -アルキニルオキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_2 - C_8$ -ハロゲノアルキニルオキシ、 $C_3 - C_7$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_7$ -シクロアルキル- $C_1 - C_8$ -アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_3 - C_7$ -ハロゲノシクロアルキル、ホルミル、ホルミルオキシ、ホルミルアミノ、カルボキシ、カルバモイル、 N -ヒドロキシカルバモイル、カルバメート、(ヒドロキシイミノ)- $C_1 - C_8$ -アルキル、 $C_1 - C_8$ -アルキルカルボニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_8$ -ハロゲノアルキルカルボニル、 $C_1 - C_8$ -アルキルカルバモイル、ジ- $C_1 - C_8$ -アルキルカルバモイル、 $N - C_1 - C_8$ -アルキルオキシカルバモイル、 $C_1 - C_8$ -アルコキシカルバモイル、 $N - C_1 - C_8$ -アルキル- $C_1 - C_8$ -アルコキシカルバモイル、 $C_1 - C_8$ -アルコキシカルボニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_8$ -ハロゲノアルコキシカルボニル、 $C_1 - C_8$ -アルキルアミノカルボニル、ジ- $C_1 - C_8$ -アルキルアミノカルボニル、 $C_1 - C_8$ -アルキルカルボニルオキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_8$ -ハロゲノアルキルカルボニルオキシ、 $C_1 - C_8$ -アルキルカルボニルアミノ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_8$ -ハロゲノアルキルカルボニルアミノ、 $C_1 - C_8$ -アルキルアミノカルボニルオキシ、ジ- $C_1 - C_8$ -アルキルアミノカルボニルオキシ、 $C_1 - C_8$ -アルキルオキシカルボニルオキシ、 $C_1 - C_8$ -アルキルスルフェニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_8$ -ハロゲノアルキルスルフェニル、 $C_1 - C_8$ -アルキルスルフィニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_8$ -ハロゲノアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_8$ -アルキルスルホニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_8$ -ハロゲノアルキルスルホニル、 $C_1 - C_8$ -アルコキシイミノ、($C_1 - C_8$ -アルコキシイミノ)- $C_1 - C_8$ -ア

10

20

30

40

50

ルキル、(C₁ - C₈ - アルケニルオキシイミノ) - C₁ - C₈ - アルキル、(C₁ - C₈ - アルキニルオキシイミノ) - C₁ - C₈ - アルキル、(ベンジルオキシイミノ) - C₁ - C₈ - アルキル、トリ(C₁ - C₈ - アルキル)シリル、トリ(C₁ - C₈ - アルキル)シリル - C₁ - C₈ - アルキル、最大5個のQ基で置換されていることができるベンジルオキシ、最大5個のQ基で置換されていることができるベンジルスルファニル、最大5個のQ基で置換されていることができるベンジリアミノ、最大6個のQ基で置換されていることができるナフチル、最大5個のQ基で置換されていることができるフェノキシ、最大5個のQ基で置換されていることができるフェニリアミノ、最大5個のQ基で置換されていることができるフェニルスルファニル、最大5個のQ基で置換されていることができるフェニルメチレン、最大5個のQ基で置換されていることができるフェニル、最大4個のQ基で置換されていることができるピリジニルおよび最大4個のQ基で置換されていることができるピリジニルオキシを表し、

10

2つの置換基Xは、これらが結合している連続した炭素原子と一緒にあって、同じもしくは異なっていることができる最大4個のQ基で置換されていることができる、5もしくは6員の飽和の炭素環もしくは複素環を形成していることができ、

nは、1、2、3、4もしくは5を表し、

Rは、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アミノ、スルファニル、ペンタフルオロ - 6 - スルファニル、C₁ - C₈ - アルキルアミノ、ジ - C₁ - C₈ - アルキルアミノ、トリ(C₁ - C₈ - アルキル)シリル、C₁ - C₈ - アルキルスルファニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₈ - ハロゲノアルキルスルファニル、C₁ - C₈ - アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₈ - ハロゲノアルキル、C₂ - C₈ - アルケニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₂ - C₈ - ハロゲノアルケニル、C₂ - C₈ - アルキニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₂ - C₈ - ハロゲノアルキニル、C₁ - C₈ - アルコキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₈ - ハロゲノアルコキシ、C₂ - C₈ - アルケニルオキシ、C₂ - C₈ - アルキニルオキシ、C₃ - C₇ - シクロアルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキル - C₁ - C₈ - アルキル、C₁ - C₈ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₈ - アルキルスルホニル、C₁ - C₈ - アルコキシイミノ、(C₁ - C₈ - アルコキシイミノ) - C₁ - C₈ - アルキル、(ベンジルオキシイミノ) - C₁ - C₈ - アルキル、フェノキシ、ベンジルオキシ、ベンジルスルファニル、ベンジリアミノ、ナフチル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むハロゲノフェノキシ、C₁ - C₈ - アルキルカルボニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₈ - ハロゲノアルキルカルボニル、C₁ - C₈ - アルコキシカルボニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₈ - ハロゲノアルコキシカルボニル、C₁ - C₈ - アルキルアミノカルボニル、ジ - C₁ - C₈ - アルキルアミノカルボニルを表し、

20

30

Qは、同じもしくは異なっていることができ、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁ - C₈ - アルキル、C₁ - C₈ - アルコキシ、C₁ - C₈ - アルキルスルファニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₈ - ハロゲノアルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₈ - ハロゲノアルコキシ、トリ(C₁ - C₈)アルキルシリルおよびトリ(C₁ - C₈)アルキルシリル - C₁ - C₈ - アルキルを表す。]の化合物、ならびにこの塩、N - 酸化物、金属錯体、半金属錯体および光学活性または幾何異性体。

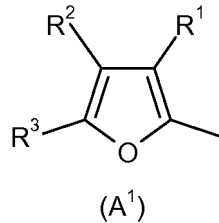
40

【請求項2】

Aが、

- 式(A¹)

【化2】



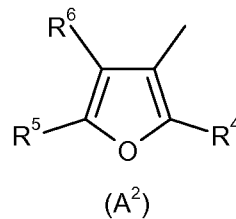
(式中：

R¹ から R³ は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₅ - アルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルコキシを表す。)の複素環、

- 式(A²)

10

【化3】



(式中：

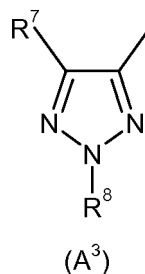
R⁴ から R⁶ は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₅ - アルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルコキシを表す。)の複素環、

- 式(A³)

20

30

【化4】



(式中：

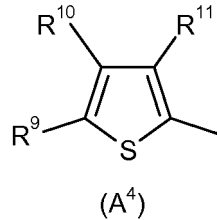
R⁷ は、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₅ - アルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルコキシを表し、

R⁸ は、水素原子もしくはC₁ - C₅ - アルキルを表す。)の複素環、

- 式(A⁴)

40

【化5】



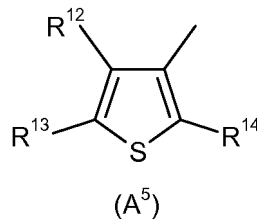
(式中：

R⁹ から R¹¹ は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキル、アミノ、C₁ - C₅ - アルコキシ、C₁ - C₅ - アルキルスルファニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルコキシを表す。)の複素環、

- 式 (A⁵)

10

【化6】



(式中：

R¹² および R¹³ は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキル、C₁ - C₅ - アルコキシ、アミノ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルコキシを表し、

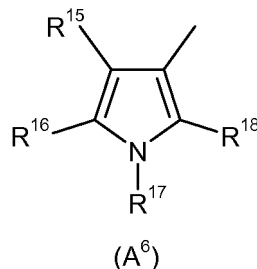
R¹⁴ は、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキル、C₁ - C₅ - アルコキシ、アミノ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルコキシを表す。)の複素環、

- 式 (A⁶)

20

30

【化7】



(式中：

R¹⁵ は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C₁ - C₅ - アルキル、C₁ - C₅ - アルコキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルを表し、

R¹⁶ および R¹⁸ は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルコシカルボニル、C₁ - C₅ - アルキル、同じもしくは異なっ

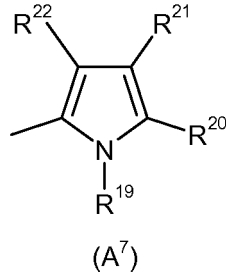
40

50

いることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルを表し、

R¹⁷ は、水素原子またはC₁ - C₅ - アルキルを表す。)の複素環、
- 式(A⁷)

【化8】



10

(式中:

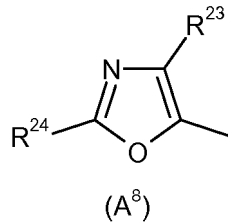
R¹⁹ は、水素原子またはC₁ - C₅ - アルキルを表し、

R²⁰ から R²² は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルを表す。)の複素環、

- 式(A⁸)

20

【化9】



30

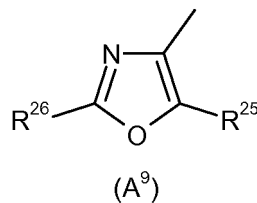
(式中:

R²³ は、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルを表し、

R²⁴ は、水素原子またはC₁ - C₅ - アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルを表す。)の複素環、

- 式(A⁹)

【化10】



40

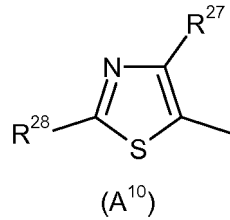
(式中:

R²⁵ は、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルを表し、

50

R^{26} は、水素原子、 $C_1 - C_5$ - アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルキルを表す。) の複素環、
- 式 (A¹⁰)

【化11】



10

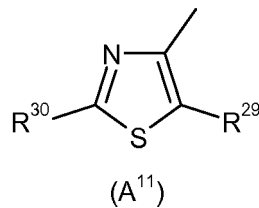
(式中:

R^{27} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_5$ - アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルキルを表し、

R^{28} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_5$ - アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルコキシ、アミノ、 $C_1 - C_5$ - アルキルアミノまたはジ ($C_1 - C_5$ - アルキル) アミノを表す。) の複素環、

- 式 (A¹¹)

【化12】



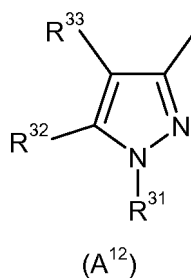
(式中:

R^{29} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_5$ - アルキル、 $C_1 - C_5$ - アルコキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルキルを表し、

R^{30} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_5$ - アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルコキシ、アミノ、 $C_1 - C_5$ - アルキルアミノまたはジ ($C_1 - C_5$ - アルキル) アミノを表す。) の複素環、

- 式 (A¹²)

【化13】



(式中:

50

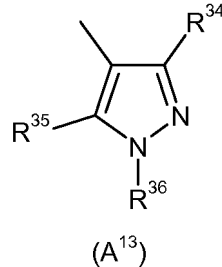
R^{31} は、水素原子または $C_1 - C_5$ - アルキルを表し、

R^{32} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_5$ - アルキルまたは同じもしくは異なることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルキルを表し、

R^{33} は、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ、 $C_1 - C_5$ - アルキル、 $C_1 - C_5$ - アルコキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルキルを表す。) の複素環、

- 式 (A^{13})

【化14】



10

(式中:

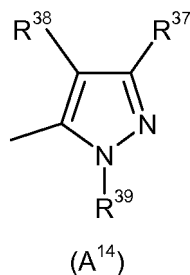
R^{34} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_5$ - アルキル、 $C_3 - C_5$ - シクロアルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_5$ - アルコキシ、 $C_2 - C_5$ - アルキニルオキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルコキシを表し、

R^{35} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_5$ - アルキル、シアノ、 $C_1 - C_5$ - アルコキシ、 $C_1 - C_5$ - アルキルスルファニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルコキシ、アミノ、 $C_1 - C_5$ - アルキルアミノまたはジ ($C_1 - C_5$ - アルキル) アミノを表し、

R^{36} は、水素原子または $C_1 - C_5$ - アルキルを表す。) の複素環、

- 式 (A^{14})

【化15】



20

30

40

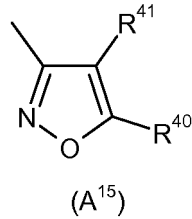
(式中:

R^{37} および R^{38} は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_5$ - アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_5$ - アルコキシまたは $C_1 - C_5$ - アルキルスルファニルを表し、

R^{39} は、水素原子または $C_1 - C_5$ - アルキルを表す。) の複素環、

- 式 (A^{15})

【化16】

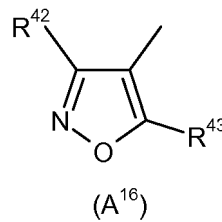


(式中：

R⁴⁰ および R⁴¹ は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルを表す。)の複素環、

- 式(A¹⁶)

【化17】

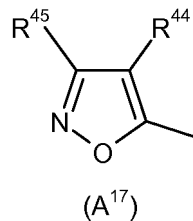


(式中：

R⁴² および R⁴³ は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルまたはアミノを表す。)の複素環、

- 式(A¹⁷)

【化18】

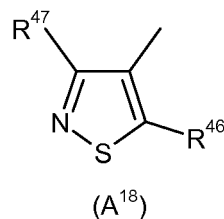


(式中：

R⁴⁴ および R⁴⁵ は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルを表す。)の複素環、

- 式(A¹⁸)

【化19】



(式中：

R⁴⁷ は、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキルまたは同じもしくは異なっ

10

20

30

40

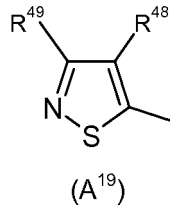
50

ていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキルを表し、

R⁴⁶は、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキルまたはC₁-C₅-アルキルスルファニルを表す。)の複素環、

- 式(A¹⁹)

【化20】



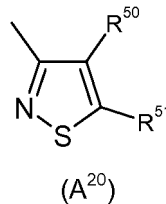
10

(式中:

R⁴⁹およびR⁴⁸は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキル、C₁-C₅-アルコキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキルを表す。)の複素環、

- 式(A²⁰)

【化21】



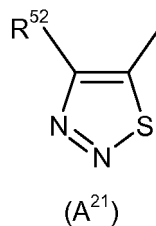
20

(式中:

R⁵⁰およびR⁵¹は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキル、C₁-C₅-アルコキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキルを表す。)の複素環、

- 式(A²¹)

【化22】



30

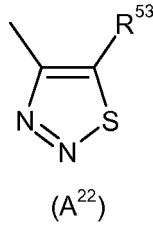
(式中:

R⁵²は、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキルを表す。)の複素環、

- 式(A²²)

40

【化 2 3】

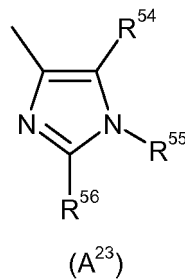


(式中：

R⁵³ は、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大 9 個のハロゲン原子を含む C₁ - C₅ - ハロゲノアルキルを表す。) の複素環、

- 式 (A²³)

【化 2 4】



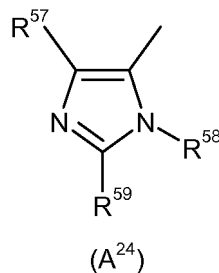
(式中：

R⁵⁴ および R⁵⁶ は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大 9 個のハロゲン原子を含む C₁ - C₅ - ハロゲノアルキルを表し、

R⁵⁵ は、水素原子または C₁ - C₅ - アルキルを表す。) の複素環、

- 式 (A²⁴)

【化 2 5】



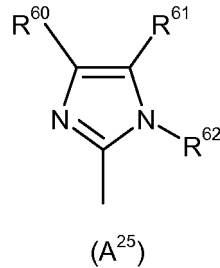
(式中：

R⁵⁷ および R⁵⁹ は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大 9 個のハロゲン原子を含む C₁ - C₅ - ハロゲノアルキルを表し、

R⁵⁸ は、水素原子または C₁ - C₅ - アルキルを表す。) の複素環、

- 式 (A²⁵)

【化26】



10

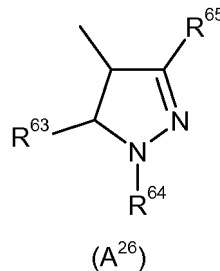
(式中：

R⁶⁰ および R⁶¹ は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキルを表し、

R⁶² は、水素原子またはC₁-C₅-アルキルを表す。)の複素環、

- 式(A²⁶)

【化27】



20

(式中：

R⁶⁵ は、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキル、C₃-C₅-シクロアルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキル、C₁-C₅-アルコキシ、C₂-C₅-アルキニルオキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルコキシを表し、

R⁶³ は、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキル、シアノ、C₁-C₅-アルコキシ、C₁-C₅-アルキルスルファニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルコキシ、アミノ、C₁-C₅-アルキルアミノまたはジ(C₁-C₅-アルキル)アミノを表し、

R⁶⁴ は、水素原子またはC₁-C₅-アルキルを表す。)の複素環

からなるリストから選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

Aが、A²、A⁶、A¹⁰およびA¹³からなるリストから選択される、請求項2に記載の化合物。

40

【請求項4】

Z¹が、同じもしくは異なっていることができ、ハロゲン原子、C₁-C₈-アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₈-ハロゲノアルキル、C₁-C₈-アルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₈-ハロゲノアルコキシからなるリストから選択することができる最大10個の基もしくは原子で置換されているC₃-C₇-シクロアルキルを表す、請求項1から3に記載の化合物。

【請求項5】

Z¹が、置換されていないC₃-C₇-シクロアルキルを表す、請求項1から4に記載

50

の化合物。

【請求項 6】

Z¹ がシクロプロピルを表す、請求項 1 から 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

X が、同じもしくは異なっていることができ、ハロゲン原子、C₁ - C₈ - アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大 9 個のハロゲン原子を含む C₁ - C₈ - ハロゲノアルキル、トリ (C₁ - C₈ - アルキル) シリル、C₁ - C₈ - アルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大 9 個のハロゲン原子を含む C₁ - C₈ - ハロゲノアルコキシを表す、または 2 つの連続した置換基 X が、フェニル環と一緒に、置換されたもしくは置換されていない 1, 3 - ベンゾジオキサリル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - キノキサリル、3, 4 - ジヒドロ - 2 H - 1, 4 - ベンゾオキサジニル、1, 4 - ベンゾジオキサニル、インダニル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラニル、インドリニルを形成している、請求項 1 から 6 に記載の化合物。

10

【請求項 8】

R が、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C₁ - C₈ - アルキルアミノ、ジ - C₁ - C₈ - アルキルアミノ、トリ (C₁ - C₈ - アルキル) シリル、C₁ - C₈ - アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大 9 個のハロゲン原子を含む C₁ - C₈ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₈ - アルコキシ、同じもしくは異なっていることができる最大 9 個のハロゲン原子を含む C₁ - C₈ - ハロゲノアルコキシ、C₁ - C₈ - アルキルスルファニル、アミノ、ニトロ、C₁ - C₈ - アルコキシカルボニル、C₂ - C₈ - アルキニルオキシを表す、請求項 1 から 7 に記載の化合物。

20

【請求項 9】

活性成分として、請求項 1 から 8 に記載の式 (I) の化合物の有効量および農業上許容される支持体、担体または増量剤を含む殺真菌剤組成物。

【請求項 10】

農学的に有効な実質的に植物に有毒でない量の請求項 1 から 8 に記載の化合物または請求項 9 に記載の組成物を、植物が生育しているもしくは生育し得る土壤に、植物の葉および/もしくは果実に、または植物の種子に施用することを特徴とする、作物の植物病原性菌類を防除するための方法。

【発明の詳細な説明】

30

【技術分野】

【0001】

本発明は、N - シクロアルキル - ベンジル - チオカルボキサミドまたは N - シクロアルキル - ベンジル - N - 置換カルボキサミドアミド誘導体、これらの調製の方法、(特に殺真菌剤組成物の形態での) 殺真菌剤活性剤としてのこれらの使用、およびこれらの化合物または組成物を使用した(特に植物の) 植物病原性真菌類の防除のための方法に関する。

【背景技術】

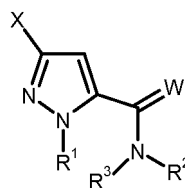
【0002】

国際特許出願 WO - 96 / 38419 において、特定の 2 - ピリジル - メチレン - チオカルボキサミド誘導体は、以下の式：

40

【0003】

【化 1】



(式中、X は、ハロゲンを表し、W は、硫黄原子を表すことができ、R¹ は、C₁ - C₄ - アルキルを表すことができ、R² は、C₃ - C₇ - シクロアルキルを表すことができ、

50

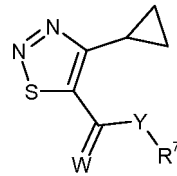
R³ は、様々な置換基、特にフェニルを表すことができる。)の多数の化合物の広範囲の開示に一般的に包含されている。しかし、この文献は、チオカルボキサミド残基の窒素原子をシクロアルキルで置換することができるこのような化合物を選択することを特に開示しておらず示唆もしていない。

【0004】

国際特許出願WO - 06 / 098128において、特定の2 - ピリジル - メチレン - チオカルボキサミド誘導体は、以下の式：

【0005】

【化2】



10

(式中、Wは、硫黄原子を表すことができ、Yは、N - シクロアルキルを表すことができ、R⁷ は、様々な置換基、特にフェニルを表すことができる。)の多数の化合物の広範囲の開示に一般的に包含されている。しかし、この文献は、チオカルボキサミド残基の窒素原子をシクロアルキルで置換することができるこのような化合物を選択することを特に開示しておらず示唆もしていない。

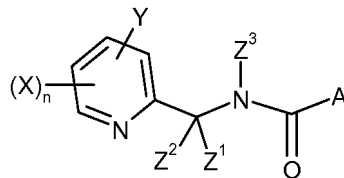
20

【0006】

国際特許出願WO - 06 / 120224は、以下の式：

【0007】

【化3】



30

の2 - ピリジル - メチレン - カルボキサミド誘導体を開示しているが、本発明による殺真菌剤のN - ベンジル - (チオカルボキサミドまたはカルボキサミドアミド)誘導体を調製するためのヒントはなかった。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0008】

【特許文献1】国際公開第96 / 38419号

【特許文献2】国際公開第06 / 098128号

【特許文献3】国際公開第06 / 120224号

【発明の概要】

40

【発明が解決しようとする課題】

【0009】

活性成分に対する耐性株の発達を回避または抑制するために新規農薬化合物を使用することに関して、農薬分野において常に高い関心もたれている。さらにまた、既知化合物と少なくとも同等の効力を維持しながら、同時に、活性化合物の使用量を低減するために、既知化合物よりも活性が高い新規化合物を使用することに関して、高い関心もたれている。

【課題を解決するための手段】

【0010】

本発明者らは、上記で記載した効果または利点を示す化合物の新規ファミリーを見出し

50

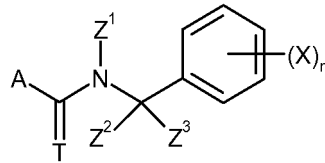
た。

【0011】

したがって、本発明は、式(I)

【0012】

【化4】



(I)

10

[式中、

・Aは、最大4個のR基で置換されていることができる、炭素に結合した、不飽和もしくは部分飽和の5員ヘテロシクリル基を表し、

・Tは、S、N-R^a、N-OR^a、N-NR^aR^bもしくはN-CNを表し、

・Z¹は、置換されていないC₃-C₇-シクロアルキル、または(同じもしくは異なっていることができ、ハロゲン原子、シアノ、C₁-C₈-アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₈-ハロゲノアルキル、C₁-C₈-アルコキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₈-ハロゲノアルコキシ、C₁-C₈-アルコキシカルボニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₈-ハロゲノアルコキシカルボニル、C₁-C₈-アルキルアミノカルボニル、ジ-C₁-C₈-アルキルアミノカルボニルからなるリストから選択することができる最大10個の原子もしくは基で置換されている)C₃-C₇-シクロアルキルを表し、

20

・Z²およびZ³は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、C₁-C₈-アルキル、C₂-C₈-アルケニル、C₂-C₈-アルキニル、シアノ、ニトロ、ハロゲン原子、C₁-C₈-アルコキシ、C₂-C₈-アルケニルオキシ、C₂-C₈-アルキニルオキシ、C₃-C₇-シクロアルキル、C₁-C₈-アルキルスルフェニル、アミノ、C₁-C₈-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₈-アルキルアミノ、C₁-C₈-アルコキシカルボニル、C₁-C₈-アルキルカルバモイル、ジ-C₁-C₈-アルキルカルバモイル、N-C₁-C₈-アルキル-C₁-C₈-アルコキシカルバモイルを表し、または

30

・Z²およびZ³は、これらが結合している炭素原子と一緒に置換されたもしくは置換されていないC₃-C₇-シクロアルキルを形成していることができ、

・Xは、同じもしくは異なっていることができ、ハロゲン原子、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、スルファニル、アミノ、ペンタフルオロ-6-スルファニル、C₁-C₈-アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₈-ハロゲノアルキル、C₁-C₈-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₈-アルキルアミノ、C₁-C₈-アルコキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₈-ハロゲノアルコキシ、C₁-C₈-アルコキシ-C₁-C₈-アルキル、C₁-C₈-アルキルスルファニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₈-ハロゲノアルキルスルファニル、C₂-C₈-アルケニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₂-C₈-ハロゲノアルケニル、C₂-C₈-アルキニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₂-C₈-ハロゲノアルキニル、C₂-C₈-アルケニルオキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₂-C₈-ハロゲノアルケニルオキシ、C₂-C₈-アルキニルオキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₂-C₈-ハロゲノアルキニルオキシ、C₃-C₇-シクロアルキル、C₃-C₇-シクロアルキル-C₁-C₈

40

50

- アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む C_3 - C_7 - ハロゲノシクロアルキル、ホルミル、ホルミルオキシ、ホルミルアミノ、カルボキシ、カルバモイル、N - ヒドロキシカルバモイル、カルバメート、(ヒドロキシイミノ) - C_1 - C_8 - アルキル、 C_1 - C_8 - アルキルカルボニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む C_1 - C_8 - ハロゲノアルキルカルボニル、 C_1 - C_8 - アルキルカルバモイル、ジ - C_1 - C_8 - アルキルカルバモイル、N - C_1 - C_8 - アルキルオキシカルバモイル、 C_1 - C_8 - アルコキシカルバモイル、N - C_1 - C_8 - アルキル - C_1 - C_8 - アルコキシカルバモイル、 C_1 - C_8 - アルコキシカルボニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む C_1 - C_8 - ハロゲノアルコキシカルボニル、 C_1 - C_8 - アルキルアミノカルボニル、ジ - C_1 - C_8 - アルキルアミノカルボニル、 C_1 - C_8 - アルキルカルボニルオキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む C_1 - C_8 - ハロゲノアルキルカルボニルオキシ、 C_1 - C_8 - アルキルカルボニルアミノ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む C_1 - C_8 - ハロゲノアルキルカルボニルアミノ、 C_1 - C_8 - アルキルアミノカルボニルオキシ、ジ - C_1 - C_8 - アルキルアミノカルボニルオキシ、 C_1 - C_8 - アルキルオキシカルボニルオキシ、 C_1 - C_8 - アルキルスルフェニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む C_1 - C_8 - ハロゲノアルキルスルフェニル、 C_1 - C_8 - アルキルスルフィニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む C_1 - C_8 - ハロゲノアルキルスルフィニル、 C_1 - C_8 - アルキルスルホニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む C_1 - C_8 - ハロゲノアルキルスルホニル、 C_1 - C_8 - アルコキシイミノ、(C_1 - C_8 - アルコキシイミノ) - C_1 - C_8 - アルキル、(C_1 - C_8 - アルケニルオキシイミノ) - C_1 - C_8 - アルキル、(C_1 - C_8 - アルキニルオキシイミノ) - C_1 - C_8 - アルキル、(ベンジルオキシイミノ) - C_1 - C_8 - アルキル、トリ(C_1 - C_8 - アルキル)シリル、トリ(C_1 - C_8 - アルキル)シリル - C_1 - C_8 - アルキル、最大5個のQ基で置換されていることができるベンジルオキシ、最大5個のQ基で置換されていることができるベンジルスルファニル、最大5個のQ基で置換されていることができるベンジルアミノ、最大6個のQ基で置換されていることができるナフチル、最大5個のQ基で置換されていることができるフェノキシ、最大5個のQ基で置換されていることができるフェニルアミノ、最大5個のQ基で置換されていることができるフェニルスルファニル、最大5個のQ基で置換されていることができるフェニルメチレン、最大5個のQ基で置換されていることができるフェニル、最大4個のQ基で置換されていることができるピリジニルおよび最大4個のQ基で置換されていることができるピリジニルオキシを表し、

・2つの置換基Xは、これらが結合している連続した炭素原子と一緒にあって、同じもしくは異なっていることができる最大4個のQ基で置換されていることができる、5もしくは6員の飽和の炭素環もしくは複素環を形成していることができ、

・nは、1、2、3、4もしくは5を表し、

・Rは、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アミノ、スルファニル、ペンタフルオロ - 6 - スルファニル、 C_1 - C_8 - アルキルアミノ、ジ - C_1 - C_8 - アルキルアミノ、トリ(C_1 - C_8 - アルキル)シリル、 C_1 - C_8 - アルキルスルファニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む C_1 - C_8 - ハロゲノアルキルスルファニル、 C_1 - C_8 - アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む C_1 - C_8 - ハロゲノアルキル、 C_2 - C_8 - アルケニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む C_2 - C_8 - ハロゲノアルケニル、 C_2 - C_8 - アルキニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む C_2 - C_8 - ハロゲノアルキニル、 C_1 - C_8 - アルコキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む C_1 - C_8 - ハロゲノアルコキシ、 C_2 - C_8 - アルケニルオキシ、 C_2 - C_8 - アルキニルオキシ、 C_3 - C_7 - シクロアルキル、 C_3 - C_7 - シ

10

20

30

40

50

クロアルキル - C₁ - C₈ - アルキル、C₁ - C₈ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₈ - アルキルスルホニル、C₁ - C₈ - アルコキシミノ、(C₁ - C₈ - アルコキシミノ) - C₁ - C₈ - アルキル、(ベンジルオキシミノ) - C₁ - C₈ - アルキル、フェノキシ、ベンジルオキシ、ベンジルスルファニル、ベンジリアミノ、ナフチル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むハロゲノフェノキシ、C₁ - C₈ - アルキルカルボニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₈ - ハロゲノアルキルカルボニル、C₁ - C₈ - アルコキシカルボニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₈ - ハロゲノアルコキシカルボニル、C₁ - C₈ - アルキルアミノカルボニル、ジ - C₁ - C₈ - アルキルアミノカルボニルを表し、

10

・R^aおよびR^bは、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、C₁ - C₈ - アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₈ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₈ - アルコキシ - C₁ - C₈ - アルキル、C₂ - C₈ - アルケニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₂ - C₈ - ハロゲノアルケニル、C₂ - C₈ - アルキニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₂ - C₈ - ハロゲノアルキニル、C₃ - C₇ - シクロアルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキル - C₁ - C₈ - アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₃ - C₇ - ハロゲノシクロアルキル、ホルミル、C₁ - C₈ - アルキルカルボニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₈ - ハロゲノアルキルカルボニル、C₁ - C₈ - アルキルスルホニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₈ - ハロゲノアルキルスルホニル、最大5個のQ基で置換されていることができるフェニル、最大6個のQ基で置換されていることができるナフチル、最大5個のQ基で置換されていることができるフェニルメチレン、最大5個のQ基で置換されていることができるフェニルスルホニルを表し、

20

・Qは、同じもしくは異なっていることができ、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁ - C₈ - アルキル、C₁ - C₈ - アルコキシ、C₁ - C₈ - アルキルスルファニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₈ - ハロゲノアルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₈ - ハロゲノアルコキシ、トリ(C₁ - C₈)アルキルシリルおよびトリ(C₁ - C₈)アルキルシリル - C₁ - C₈ - アルキルを表す。]

30

のN - シクロアルキル - ベンジル - チオカルボキサミドまたはN - シクロアルキル - ベンジル - N - 置換 - カルボキシミドアミド誘導体、ならびにこの塩、N - 酸化物、金属錯体、半金属錯体および光学活性または幾何異性体を提供する。

【発明を実施するための形態】

【0013】

本発明による化合物のいずれも、化合物中の不斉中心の数に応じて1種または複数の光学またはキラリ異性体形態で存在し得る。したがって、本発明は、等しくすべての光学異性体およびこれらのラセミまたは不均一(scalemic)混合物(「不均一」という用語は、様々な割合の鏡像異性体の混合物を意味する。)、ならびにすべての割合におけるすべての可能な立体異性体の混合物に関する。ジアステレオ異性体および/または光学異性体は、当業者に自体周知である方法によって分離し得る。

40

【0014】

本発明による化合物のいずれも、化合物中の二重結合の数に応じて1種または複数の幾何異性体形態でも存在し得る。したがって、本発明は、等しくすべての幾何異性体およびすべての割合におけるすべての可能な混合物に関する。幾何異性体は、当業者に自体周知である一般的な方法によって分離し得る。

【0015】

本発明による化合物のために、次の総称は、次の意味で一般的に使用される。

【0016】

50

- ・ハロゲンは、フッ素、臭素、塩素またはヨウ素のいずれか1つを意味し、
- ・ヘテロ原子は、窒素、酸素または硫黄であってよく、
- ・任意のアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基は、直鎖または分枝であってよく、
- ・アミノ基または同じまたは異なっていることができる2つの置換基で置換されている任意の他のアミノ含有基のアミノ部分の場合、この2つの置換基は、これらが結合している窒素と一緒にあって、置換されていることができるおよび他のヘテロ原子を含んでよいヘテロシクリル基、好ましくは5から7員ヘテロシクリル基、例えばモルホリノまたはピペリジニルを形成していることができる。

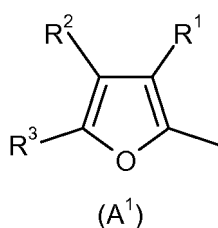
【0017】

本発明による好ましい化合物は、Aが、

- 式(A¹)

【0018】

【化5】



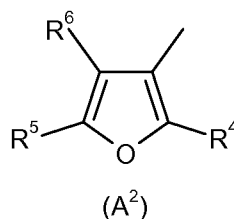
(式中：

R¹からR³は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキル、C₁-C₅-アルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルコキシを表す。)の複素環、

- 式(A²)

【0019】

【化6】



(式中：

R⁴からR⁶は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキル、C₁-C₅-アルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルコキシを表す。)の複素環、

- 式(A³)

【0020】

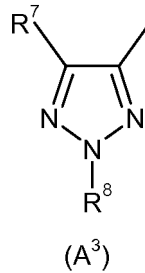
10

20

30

40

【化7】



(式中：

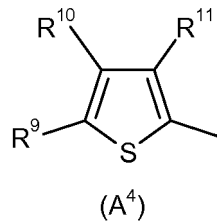
R⁷ は、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₅ - アルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルコキシを表し、

R⁸ は、水素原子もしくはC₁ - C₅ - アルキルを表す。)の複素環、

- 式(A⁴)

【0021】

【化8】



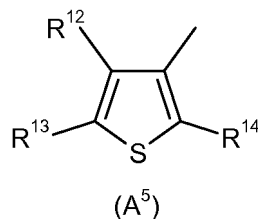
(式中：

R⁹ から R¹¹ は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキル、アミノ、C₁ - C₅ - アルコキシ、C₁ - C₅ - アルキルスルファニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルコキシを表す。)の複素環、

- 式(A⁵)

【0022】

【化9】



(式中：

R¹² および R¹³ は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキル、C₁ - C₅ - アルコキシ、アミノ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルコキシを表し、

R¹⁴ は、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキル、C₁ - C₅ - アルコキシ、アミノ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲ

10

20

30

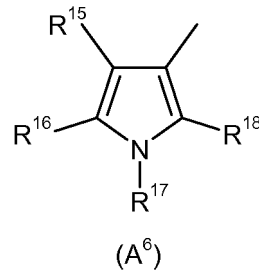
40

50

ン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルコキシを表す。) の複素環、
 - 式 (A⁶)

【0023】

【化10】



10

(式中：

R^{15} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 - C_5$ - アルキル、 $C_1 - C_5$ - アルコキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルキルを表し、

R^{16} および R^{18} は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_5$ - アルコシカルボニル、 $C_1 - C_5$ - アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルキルを表し、

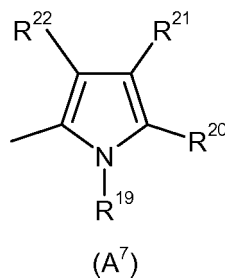
20

R^{17} は、水素原子または $C_1 - C_5$ - アルキルを表す。) の複素環、

- 式 (A⁷)

【0024】

【化11】



30

(式中：

R^{19} は、水素原子または $C_1 - C_5$ - アルキルを表し、

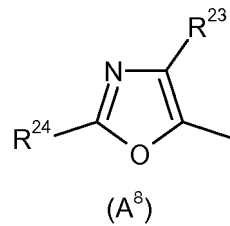
R^{20} から R^{22} は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_5$ - アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ - ハロゲノアルキルを表す。) の複素環、

40

- 式 (A⁸)

【0025】

【化 1 2】



(式中：

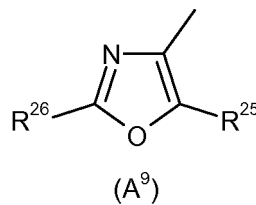
R²³は、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキルを表し

、
R²⁴は、水素原子またはC₁-C₅-アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキルを表す。)の複素環、

- 式(A⁹)

【0026】

【化 1 3】



(式中：

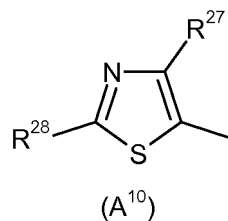
R²⁵は、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキルを表し

、
R²⁶は、水素原子、C₁-C₅-アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキルを表す。)の複素環、

- 式(A¹⁰)

【0027】

【化 1 4】



(式中：

R²⁷は、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキルを表し

、
R²⁸は、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルコキシ、アミノ、C₁-C₅-アルキルアミノまたはジ(C₁-C₅-アルキル)アミノ

10

20

30

40

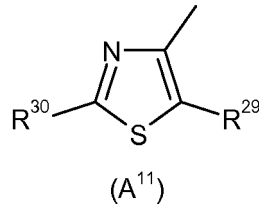
50

を表す。)の複素環、

- 式 (A¹¹)

【0028】

【化15】



10

(式中：

R²⁹は、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキル、C₁-C₅-アルコキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキルを表し、

R³⁰は、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルコキシ、アミノ、C₁-C₅-アルキルアミノまたはジ(C₁-C₅-アルキル)アミノ

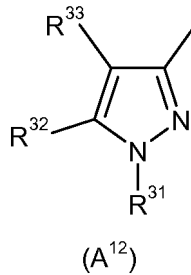
20

を表す。)の複素環、

- 式 (A¹²)

【0029】

【化16】



30

(式中：

R³¹は、水素原子またはC₁-C₅-アルキルを表し、

R³²は、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキルを表し、

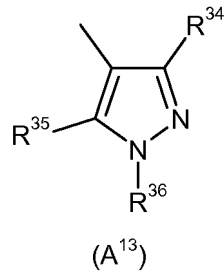
R³³は、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ、C₁-C₅-アルキル、C₁-C₅-アルコキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキルを表す。)の複素環、

40

- 式 (A¹³)

【0030】

【化17】



10

(式中：

R³⁴は、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキル、C₃-C₅-シクロアルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキル、C₁-C₅-アルコキシ、C₂-C₅-アルキニルオキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルコキシを表し、

R³⁵は、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキル、シアノ、C₁-C₅-アルコキシ、C₁-C₅-アルキルスルファニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルコキシ、アミノ

20

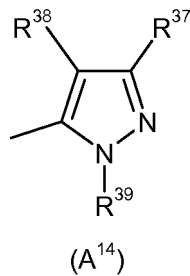
、C₁-C₅-アルキルアミノまたはジ(C₁-C₅-アルキル)アミノを表し、

R³⁶は、水素原子またはC₁-C₅-アルキルを表す。)の複素環、

-式(A¹⁴)

【0031】

【化18】



30

(式中：

R³⁷およびR³⁸は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキル、C₁-C₅-アルコキシまたはC₁-C₅-アルキルスルファニルを表し、

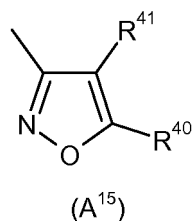
R³⁹は、水素原子またはC₁-C₅-アルキルを表す。)の複素環、

40

-式(A¹⁵)

【0032】

【化19】



50

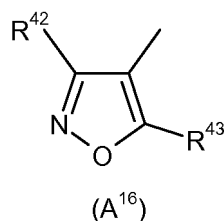
(式中：

R^{40} および R^{41} は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_5$ -アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ -ハロゲノアルキルを表す。)の複素環、

- 式 (A^{16})

【0033】

【化20】



10

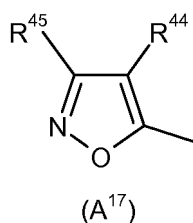
(式中：

R^{42} および R^{43} は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_5$ -アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ -ハロゲノアルキルまたはアミノを表す。)の複素環、

- 式 (A^{17})

【0034】

【化21】



20

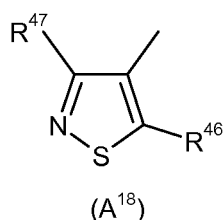
(式中：

R^{44} および R^{45} は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_5$ -アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ -ハロゲノアルキルを表す。)の複素環、

- 式 (A^{18})

【0035】

【化22】



30

40

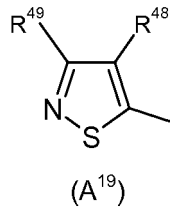
(式中：

R^{47} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_5$ -アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ -ハロゲノアルキルを表し、

R^{46} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_5$ -アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_5$ -ハロゲノアルキルまたは $C_1 - C_5$ -アルキルスルファニルを表す。)の複素環、

50

- 式 (A¹⁹)
 【0036】
 【化23】

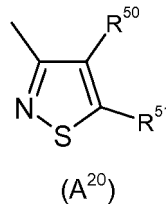


10

(式中：
 R⁴⁹ および R⁴⁸ は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキル、C₁ - C₅ - アルコキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルを表す。)の複素環、

- 式 (A²⁰)
 【0037】
 【化24】

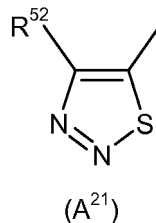
20



(式中：
 R⁵⁰ および R⁵¹ は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキル、C₁ - C₅ - アルコキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルを表す。)の複素環、

- 式 (A²¹)
 【0038】
 【化25】

30

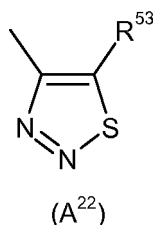


40

(式中：
 R⁵² は、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルを表す。)の複素環、

- 式 (A²²)
 【0039】

【化26】



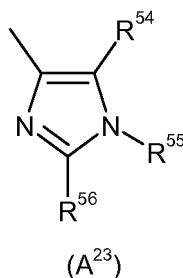
(式中：

R⁵³は、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキルを表す。)の複素環、

- 式(A²³)

【0040】

【化27】



(式中：

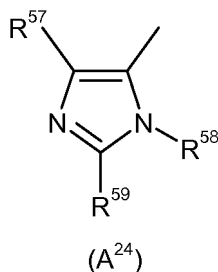
R⁵⁴およびR⁵⁶は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキルを表し、

R⁵⁵は、水素原子またはC₁-C₅-アルキルを表す。)の複素環、

- 式(A²⁴)

【0041】

【化28】



(式中：

R⁵⁷およびR⁵⁹は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₅-アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁-C₅-ハロゲノアルキルを表し、

R⁵⁸は、水素原子またはC₁-C₅-アルキルを表す。)の複素環、

- 式(A²⁵)

【0042】

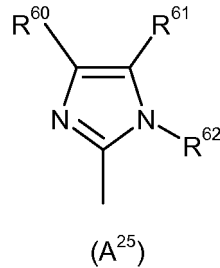
10

20

30

40

【化29】



10

(式中：

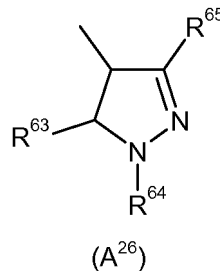
R⁶⁰ および R⁶¹ は、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキルまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキルを表し、

R⁶² は、水素原子またはC₁ - C₅ - アルキルを表す。)の複素環、

- 式(A²⁶)

【0043】

【化30】



20

(式中：

R⁶⁵ は、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキル、C₃ - C₅ - シクロアルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₅ - アルコキシ、C₂ - C₅ - アルキニルオキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルコキシを表し、

R⁶³ は、水素原子、ハロゲン原子、C₁ - C₅ - アルキル、シアノ、C₁ - C₅ - アルコキシ、C₁ - C₅ - アルキルスルファニル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₅ - ハロゲノアルコキシ、アミノ、C₁ - C₅ - アルキルアミノまたはジ(C₁ - C₅ - アルキル)アミノを表し、

R⁶⁴ は、水素原子またはC₁ - C₅ - アルキルを表す。)の複素環

からなるリストから選択される、式(I)の化合物である。

【0044】

本発明によるより好ましい化合物は、Aが、本明細書で定義されたA²、A⁶、A¹⁰ およびA¹³ からなるリストから選択される、式(I)の化合物である。

【0045】

本発明による式(I)の他の好ましい化合物は、Tが硫黄を表すものである。

【0046】

本発明による他の好ましい化合物は、Z¹が、同じもしくは異なっていることができ、ハロゲン原子、C₁ - C₈ - アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₈ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₈ - アルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含むC₁ - C₈ - ハロゲノアルコキシからなるリストから選択することができる最大10個の基もしくは原子で置

50

換されている $C_3 - C_7$ - シクロアルキルを表し、より好ましくは、 Z^1 が、置換されていない $C_3 - C_7$ - シクロアルキルを表し、さらにより好ましくは、 Z^1 がシクロプロピルを表す、式 (I) の化合物である。

【0047】

本発明による他の好ましい化合物は、 X が、同じもしくは異なっていることができ、ハロゲン原子、 $C_1 - C_8$ - アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルキル、トリ ($C_1 - C_8$ - アルキル) シリル、 $C_1 - C_8$ - アルコキシまたは同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルコキシを表す、式 (I) の化合物である。

【0048】

本発明による他のより好ましい化合物は、2つの連続した置換基 X が、フェニル環と一緒にあって、置換されたもしくは置換されていない 1, 3 - ベンジオキソリル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - キノキサリニル、3, 4 - ジヒドロ - 2H - 1, 4 - ベンゾオキサジニル、1, 4 - ベンジオキサニル、インダニル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラニル、インドリニルを形成している、式 (I) の化合物である。

【0049】

本発明による他の好ましい化合物は、 R が、同じもしくは異なっていることができ、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 - C_8$ - アルキルアミノ、ジ - $C_1 - C_8$ - アルキルアミノ、トリ ($C_1 - C_8$ - アルキル) シリル、 $C_1 - C_8$ - アルキル、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_8$ - アルコキシ、同じもしくは異なっていることができる最大9個のハロゲン原子を含む $C_1 - C_8$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_8$ - アルキルスルファニル、アミノ、ヒドロキシル、ニトロ、 $C_1 - C_8$ - アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_8$ - アルキルオキシを表す、式 (I) の化合物である。

【0050】

本発明による化合物の置換基に関する上記の選択は、様々な様式で組み合わせることができる。したがって、好ましい特徴のこれらの組合せは、本発明の化合物のサブクラスを提供する。本発明による好ましい化合物のこのようなサブクラスの例は、

- Aの好ましい特徴とT、 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 X 、 n 、RおよびQの好ましい特徴、
 - Tの好ましい特徴とA、 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 X 、 n 、RおよびQの好ましい特徴、
 - Z^1 の好ましい特徴とA、T、 Z^2 、 Z^3 、 X 、 n 、RおよびQの好ましい特徴、
 - Z^2 の好ましい特徴とA、T、 Z^1 、 Z^3 、 X 、 n 、RおよびQの好ましい特徴、
 - Z^3 の好ましい特徴とA、T、 Z^1 、 Z^2 、 X 、 n 、RおよびQの好ましい特徴、
 - X の好ましい特徴とA、T、 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 n 、RおよびQの好ましい特徴、
 - n の好ましい特徴とA、T、 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 X 、RおよびQの好ましい特徴、
 - Rの好ましい特徴とA、T、 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 X 、 n およびQの好ましい特徴、
 - Qの好ましい特徴とA、T、 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 X 、 n およびRの好ましい特徴
- を組み合わせることができる。

【0051】

本発明による化合物の置換基の好ましい特徴についての上記組合せにおいて、当該好ましい特徴は、A、T、 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 X 、 n 、RおよびQのそれぞれのさらに好ましい特徴の中から選択して、本発明による化合物の最も好ましいサブクラスを構成することもできる。

【0052】

本発明は、式 (I) の化合物を調製する方法にも関する。

【0053】

したがって、本発明のさらなる一態様によれば、次の反応スキーム：

【0054】

10

20

30

40

【化 3 1】

方法P1

[式中、A、Z¹ から Z³、X および n は、本明細書で定義された通りである。] で示されるように、T が、S を表す式 (I) の化合物の調製のための方法 P 1 が提供される。

10

【 0 0 5 5 】

方法 P 1 は、チオネート化剤の存在下で実施することができる。

【 0 0 5 6 】

式 (I I) のアミド誘導体は、既知であり、または既知方法、例えば欧州特許出願第 0 6 / 3 5 6 0 0 8 号明細書に記載されたものによって調製することができる。

【 0 0 5 7 】

本発明による方法 P 1 を実施するのに適したチオネート化剤は、硫黄 (S)、硫化水素 (H₂S)、硫化ナトリウム (Na₂S)、水硫化ナトリウム (NaHS)、硫化ホウ素 (B₂S₃)、硫化ビス (ジエチルアルミニウム) ((A l E t₂)₂S)、硫化アンモニウム ((NH₄)₂S)、五硫化リン (P₂S₅)、ローソン試薬 (2 , 4 - ビス (4 - メトキシフェニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - ジチアジホスフェタン 2 , 4 - ジスルフィド) またはポリマー支持チオネート化試薬、例えば J . Chem . Soc . Perkin 1 (2 0 0 1)、3 5 8 頁に記載されたものであってよい。

20

【 0 0 5 8 】

触媒的または化学量論的な量以上の塩基、例えば、無機または有機塩基の存在下または不存在下で、アルカリ金属炭酸塩、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸カリウム、重炭酸ナトリウム、複素環式芳香族塩基、例えば、ピリジン、ピコリン、ルチジン、コリジン、さらに第三級アミン類、例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N , N - ジメチルアニリン、N , N - ジメチル - アミノピリジンまたは N - メチルピペリジンを使用することが好ましい。

30

【 0 0 5 9 】

本発明による方法 P 1 を実施するのに適した溶媒は、慣習的な不活性有機溶媒であり得る。好ましくは、以下のものを使用する：場合によってハロゲン化されている脂肪族、脂環式または芳香族の炭化水素類、例えば、石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンまたはデカリン；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロルエタンまたはトリクロルエタン；エーテル類、例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル t - ブチルエーテル、メチル t - アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1 , 2 - ジメトキシエタンまたは 1 , 2 - ジエトキシエタン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル、プロピオニトリル、n - ブチロニトリル、i - ブチロニトリルまたはベンゾニトリル；含硫溶媒、例えば、スルホランまたは二硫化炭素。

40

【 0 0 6 0 】

本発明による方法 P 1 を実施する場合、反応温度は比較的広い範囲で様々であることができる。一般に、これらの方法は、0 から 1 6 0 の温度、好ましくは、1 0 から 1 2 0 の温度で実施する。本発明による方法に関して温度を制御する方法は、マイクロ波技術の使用である。

【 0 0 6 1 】

本発明による方法 P 1 は、一般に、大気圧下で実施する。高圧下または減圧下で実施することも可能である。

50

【0062】

本発明による方法P1を実施する場合、1モルまたは過剰の硫黄当量のチオネート化剤および1から3モルの塩基を、式(II)のアミド誘導体(I)の1モル当たり使用することができる。

【0063】

反応成分を他の割合で使用することも可能である。後処理は、既知方法によって行う。

【0064】

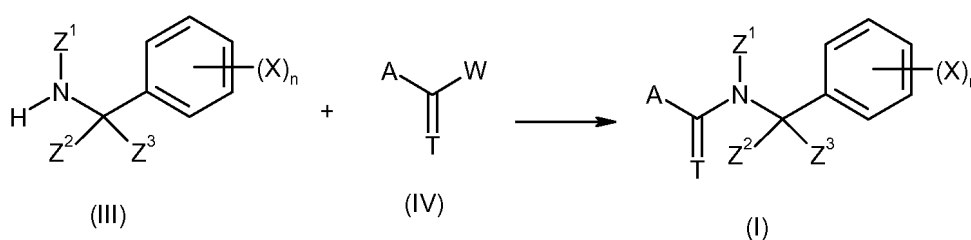
一般に、当該反応混合物を減圧下に濃縮する。依然として存在し得る不純物は、クロマトグラフィーまたは再結晶などの既知方法によって、残った残渣から除去することができる。

【0065】

本発明のさらなる一態様によれば、次の反応スキーム：

【0066】

【化32】

方法P2

[式中、

・ A、Z¹ から Z³、W¹ から W⁵ および B は、本明細書で定義された通りであり、
 ・ U² は、塩素原子またはメチルスルファニル基を表す。]で示されるように、T が、N - R^a、N - OR^a、N - NR^aR^b または N - CN からなるリストから選択される式 (I) の化合物の調製のための方法 P 2 が提供される。

【0067】

本発明による方法P2において、ステップ2は、酸結合剤の存在下および溶媒の存在下で実施することができる。

【0068】

式(III)のN-シクロアルキル-アミン誘導体は、既知であり、または既知方法、例えば、アルデヒドもしくはケトンの還元的アミノ化 (Bioorganics and Medicinal Chemistry Letters、2006、2014頁、synthesis of compounds 7 and 8)、またはイミンの還元 (Tetrahedron、2005、11689頁)、またはハロゲン、メシレートもしくはトシレートの求核置換 (Journal of Medicinal Chemistry、2002、3887頁、preparation of intermediate for compound 28) によって調製することができる。

【0069】

式(IV)のN-置換カルボキシミドイルクロリドは、既知であり、または、既知方法、例えば、Houben-Weyl、「Methoden der organischen Chemie」(1985)、E5/1、628-633頁およびPatai、「The chemistry of amidines and imidates」(1975)、296-301頁に記載されたものによって調製することができる。

【0070】

式(IV)のN-置換またはN,N-二置換ヒドラゾニルクロリドは、既知であり、または、既知方法、例えば、Tetrahedron、1991、47、447頁およびJournal of Heterocyclic Chemistry、1983、2

10

20

30

40

50

0、225頁に記載されたものによって調製することができる。

【0071】

式(IV)のN-シアノカルボキシミドイルクロリドは、既知であり、または、既知方法、例えば、Tetrahedron Letters、1968、5523頁およびBloorganic and Medicinal Chemistry、2006、4723頁に記載されたものによって調製することができる。

【0072】

本発明による方法P2を実施するのに適した酸結合剤は、このような反応に関して慣習的な無機塩基または有機塩基であり得る。好ましくは、以下のものを使用する：アルカリ土類金属もしくはアルカリ金属の水酸化物、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カルシウム、水酸化カリウム、または、他の水酸化アンモニウム誘導体；アルカリ金属炭酸塩、例えば、炭酸ナトリウム、炭素カリウム、重炭素カリウム、重炭素ナトリウム；アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属の酢酸塩、例えば、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウム；アルカリ土類金属もしくはアルカリ金属の水素化物、例えば水素化ナトリウムもしくは水素化カリウム；アルカリ土類金属もしくはアルカリ金属アルコール、例えばナトリウムメチレート、ナトリウムエチレート、ナトリウムプロピレートもしくはカリウムt-ブチレート；および、さらに、第三級アミン、例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジン、N-メチルピペリジン、N,N-ジメチルアミノピリジン、ジアザビシクロオクタン(DABCO)、ジアザビシクロノネン(DBN)またはジアザビシクロウンデセン(DBU)；またはポリマー担持酸スカベンジャー(例えば<http://www.iriris-biotech.de/downloads/scavengers.pdf>に記載のように)。

【0073】

付加的な酸結合剤を存在させないで実施することも可能である。

【0074】

本発明による方法P2を実施するのに適した溶媒は、慣習的な不活性有機溶媒であり得る。好ましくは、以下のものを使用する：場合によってハロゲン化されている脂肪族、脂環式または芳香族の炭化水素類、例えば、石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレンまたはデカリン；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロルエタンまたはトリクロルエタン；エーテル類、例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルト-ブチルエーテル、メチルト-アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、1,2-ジエトキシエタンまたはアニソール；ニトリル類、例えば、アセトニトリル、プロピオニトリル、n-ブチロニトリル、i-ブチロニトリルまたはベンゾニトリル；アミド類、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチルホルムアニリド、N-メチルピロリドンまたはヘキサメチルリン酸トリアミド；エステル類、例えば、酢酸メチルまたは酢酸エチル；スルホキシド類、例えば、ジメチルスルホキシド；または、スルホン類、例えば、スルホラン。

【0075】

本発明による方法P2を実施する場合、反応温度は比較的広い範囲で様々であることができる。一般に、これらの方法は、0 から160 の温度、好ましくは、10 から120 の温度で実施する。本発明による方法に関して温度を制御する方法は、マイクロ波技術の使用である。

【0076】

本発明による方法P2は、一般に、大気圧下で実施する。高圧下または減圧下で実施することも可能である。

【0077】

本発明による方法P2を実施する場合、式(III)のアミン誘導体は、この塩、例えば、クロロヒドレートまたは任意の他の好都合な塩として使用することができる。

10

20

30

40

50

【0078】

本発明による方法P2を実施する場合、1モルまたは過剰の式(II)のアミン誘導体および1から3モルの酸結合剤を、式(IV)のN-置換カルボキシミドイルクロリドの1モル当たり使用することができる。

【0079】

反応成分を他の割合で使用することも可能である。後処理は、既知方法によって行う。

【0080】

一般に、反応混合物は、減圧下で濃縮する。残る残渣は、既知方法、例えば、クロマトグラフィーまたは再結晶によって、依然として存在し得る不純物から取り出すことができる。

【0081】

本発明による式(II)の化合物は、本明細書に記載された方法に準じて調製することができる。それにもかかわらず、当業者が、自分の一般的な知識および利用可能な刊行物に基づいて、合成することが望まれる化合物のそれぞれの特性に応じて該方法を適合させることができるということは理解されるであろう。

【0082】

さらに別の態様において、本発明は、有効で植物に対して毒性を示さない量の式(I)の活性化化合物を含む殺菌剤組成物にも関する。

【0083】

「有効で植物に対して毒性を示さない量」という表現は、作物上に存在しているかまたはおそらく出現するであろう菌類を防除または駆除するのに十分であり、該作物について植物毒性の感知可能などのような症状も引き起こすことのない、本発明による組成物の量を意味する。このような量は、防除対象の菌類、作物の種類、気候条件、および、本発明による殺菌剤組成物に含まれている化合物に応じて、広い範囲で変動し得る。このような量は、当業者が実行可能な範囲内にある体系的な圃場試験により決定することが可能である。

【0084】

かくして、本発明により、活性成分としての有効量の式(I)の化合物、および、農業上許容される支持体、担体または増量剤を含む殺菌剤組成物が提供される。

【0085】

本発明によれば、用語「支持体(support)」は、式(I)の活性化化合物と組み合わせるまたは関連させて、特に植物の一部に対して、より容易に施用できるようにする、天然または合成の有機化合物または無機化合物を意味する。このような支持体は、したがって、一般に不活性であり、また、農業上許容されるものであるべきである。支持体は、固体であってもよいし、または、液体であってもよい。適切な支持体の例としては、クレ-、天然または合成のシリケート、シリカ、樹脂、蠟、固形肥料、水、アルコール(特に、ブタノール)、有機溶媒、鉱油および植物油、ならびに、それらの誘導体などが挙げられる。このような支持体の混合物を使用することもできる。

【0086】

本発明による組成物には、さらにまた、付加的な成分も含有させることができる。特に、該組成物には、さらに、界面活性剤を含有させることができる。該界面活性剤は、イオン性もしくは非イオン性のタイプの乳化剤、分散剤もしくは湿潤剤であることが可能である、または、このような界面活性剤の混合物であることが可能である。例えば、以下のものを挙げることができる：ポリアクリル酸塩、リグノスルホン酸塩、フェノールスルホン酸塩もしくはナフタレンスルホン酸塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールの重縮合物もしくはエチレンオキシドと脂肪酸の重縮合物もしくはエチレンオキシドと脂肪アミンの重縮合物、置換されているフェノール(特に、アルキルフェノールまたはアリールフェノール)、スルホコハク酸エステル塩、タウリン誘導体(特に、アルキルタウレート)、ポリオキシエチル化アルコールのリン酸エステルもしくはポリオキシエチル化フェノールの

10

20

30

40

50

リン酸エステル、ポリオールの脂肪酸エステル、ならびに、硫酸官能基、スルホン酸官能基およびリン酸官能基を含む上記化合物の誘導体。該活性化化合物および/または該不活性支持体が水不溶性である場合、ならびに、施用のための媒介物 (vector agent) が水である場合、一般に、少なくとも1種の界面活性剤を存在させることが必要である。好ましくは、界面活性剤の含有量は、該組成物の5重量%から40重量%であり得る。

【0087】

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

10

【0088】

一般に、本発明による組成物には、0.05から99重量%の活性化化合物、好ましくは、10から70重量%の活性化化合物を含有させることができる。

【0089】

本発明による組成物は、エアロゾルディスペンサー、カプセル懸濁液剤、冷煙霧濃厚剤 (cold fogging concentrate)、散粉性粉剤、乳剤、水中油型エマルジョン剤、油中水型エマルジョン剤、カプセル化粒剤、細粒剤、種子処理用フロアブル剤、ガス剤 (加圧下)、ガス生成剤 (gas generating product)、粒剤、温煙霧濃厚剤 (hot fogging concentrate)、大型粒剤、微粒剤、油分散性粉剤、油混和性フロアブル剤、油混和性液剤、ペースト剤、植物用棒状剤 (plant rodlet)、乾燥種子処理用粉剤、農薬粉衣種子、可溶性濃厚剤 (soluble concentrate)、可溶性粉剤、種子処理用溶液剤、懸濁液剤 (フロアブル剤)、微量散布用液剤 (ultra low volume (ULV) liquid)、微量散布用懸濁液剤 (ultra low volume (ULV) suspension)、顆粒水和剤、水分散性錠剤、泥水処理用水和剤、水溶性顆粒剤、水溶性錠剤、種子処理用水溶性粉剤および水和剤などのような、様々な形態で使用することが可能である。これらの組成物には、処理対象の植物または種子に対して噴霧装置または散粉装置のような適切な装置を用いて施用される状態にある組成物のみではなく、作物に対して施用する前に希釈することが必要な商業的な濃厚組成物も包含される。

20

30

【0090】

本発明による化合物は、さらにまた、1種または複数の殺虫剤、殺菌剤、殺細菌剤、誘引剤、殺ダニ剤もしくはフェロモン活性物質、または、生物学的活性を有する別の化合物と混合することもできる。このようにして得られた混合物は、通常、拡大された活性スペクトルを有する。別の殺菌剤化合物との混合物が特に有利である。

【0091】

適切な殺真菌剤混合相手の例は、次のリストから選択することができる。

【0092】

(1) 核酸合成の阻害剤、例えば、ベナラキシル、ベナラキシル-M、ブピリメート、クロジラコン、ジメチリモール、エチリモール、フララキシル、ヒメキサゾール、メタラキシル、メタラキシル-M、オフレース、オキサジキシルおよびオキシリン酸。

40

【0093】

(2) 有糸分裂および細胞分裂の阻害剤、例えば、ベノミル、カルベンダジム、クロルフェナゾール、ジエトフェンカルブ、エタボキサム、フベリダゾール、ペンシクロン、チアベンダゾール、チオファネート、チオファネートメチルおよびゾキサミド。

【0094】

(3) 呼吸の阻害剤、例えば、C I呼吸阻害剤としてのジフルメトリム; C I I呼吸阻害剤としてのピキサフェン、ボスカリド、カルボキシシン、フェンフラム、フルトラニル、フルオピラム、フラメトピル、フルメシクロックス、イソピラザム (9 R成分)、イソピラザム (9 S成分)、メプロニル、オキシカルボキシシン、ペンチオピラド、チフルザミド

50

; C I I I呼吸阻害剤としてのアミスルブロム、アゾキシストロピン、シアゾファミド、ジモキシストロピン、エネストロブリン、ファミキサドン、フェンアミドン、フルオキサストロピン、クレソキシム - メチル、メトミノストロピン、オリサストロピン、ピコキシストロピン、ピラクロストロピン、ピリベンカルブ、トリフロキシストロピン。

【 0 0 9 5 】

(4) 例えば、ビナパクリル、ジノカップ、フルアジナムおよびメプチルジノキャップのような脱共役剤として作用し得る化合物。

【 0 0 9 6 】

(5) A T P 産生の阻害剤、例えば、フェンチンアセテート、フェンチンクロリド、フェンチンヒドロキシドおよびシルチオファミ。

10

【 0 0 9 7 】

(6) アミノ酸および/またはタンパク質生合成の阻害剤、例えば、アンドプリム、ブラストサイジン - S、シプロジニル、カスガマイシン、カスガマイシン塩酸塩水和物、メパニピリムおよびピリメタニル。

【 0 0 9 8 】

(7) シグナル変換の阻害剤、例えば、フェンピクロニル、フルジオキソニルおよびキノキシフェン。

【 0 0 9 9 】

(8) 脂質および膜合成の阻害剤、例えば、ピフェニル、クロゾリネート、エジフェンホス、エトリジアゾール、ヨードカルブ、イプロベンホス、イプロジオン、イソプロチオラン、プロシミドン、プロパモカルブ、プロパモカルブ塩酸塩、ピラゾホス、トルクロホス - メチルおよびピンクロゾリン。

20

【 0 1 0 0 】

(9) エルゴステロール生合成の阻害剤、例えば、アルジモルフ、アザコナゾール、ピテルタノール、プロムコナゾール、シプロコナゾール、ジクロブトラゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾール - M、ドデモルフ、酢酸ドデモルフ、エポキシコナゾール、エタコナゾール、フェナリモール、フェンブコナゾール、フェンヘキサミド、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、フルキンコナゾール、フルルプリミドール、フルシラゾール、フルトリアホール、フルコナゾール、フルコナゾール - シス、ヘキサコナゾール、イマザリル、硫酸イマザリル、イミベンコナゾール、イプコナゾール、メトコナゾール、ミクロブタニル、ナフチフィン、ヌアリモール、オキシボコナゾール、バクロブトラゾール、ペフラゾエート、ペンコナゾール、ピペラリン、プロクロラズ、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、ピリブチカルブ、ピリフェノックス、キンコナゾール、シメコナゾール、スピロキサミン、テブコナゾール、テルピナフィン、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリデモルフ、トリフルミゾール、トリホリン、トリチコナゾール、ウニコナゾール、ビニコナゾールおよびポリコナゾール。

30

【 0 1 0 1 】

(1 0) 細胞壁合成の阻害剤、例えば、ベンチアバリカルブ、ジメトモルフ、フルモルフ、イプロバリカルブ、マンジプロパミド、ポリオキシシン、ポリオキシソリム、プロチオカルブ、バリダマイシン A およびバリフェナール。

40

【 0 1 0 2 】

(1 1) メラニン生合成の阻害剤、例えば、カルプロパミド、ジクロシメット、フェノキサニル、フタリド、ピロキロンおよびトリシクラゾール。

【 0 1 0 3 】

(1 2) 例えば、アシベンゾラル - S - メチル、プロベナゾールおよびチアジニルのような宿主の防御を誘導し得る化合物。

【 0 1 0 4 】

(1 3) 例えば、ボルドー液、カプタホール、キャプタン、クロロタロニル、ナフテン酸銅、酸化銅、オキシ塩化銅、銅調製物、例えば、水酸化銅、硫酸銅、ジクロフルアニド、ジチアノン、ドジン、ドジン遊離塩基、ファーバム、フルオロホルベット、ホルベット

50

、グアザチン、酢酸グアザチン、イミノクタジン、イミノクタジンアルベシル酸塩、イミノクタジン三酢酸塩、マンカップ、マンコゼブ、マンネブ、メチラム、メチラム亜鉛、オキシ銅、プロパミジン、プロピネブ、硫黄および多硫化カルシウム、チラム、トリルフルアニド、ジネブおよびジラムを含めた硫黄調製物のようなマルチサイト作用を有し得る化合物。

【0105】

(14) 例えば、2,3-ジブチル-6-クロロチエノ[2,3-d]ピリミジン-4(3H)-オン、エチル(2Z)-3-アミノ-2-シアノ-3-フェニルプロブ-2-エノエート、N-[2-(1,3-ジメチルブチル)フェニル]-5-フルオロ-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、N-{2-[1,1'-ビ(シクロプロピル)-2-イル]フェニル}-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2E)-2-(2-{[6-(3-クロロ-2-メチルフェノキシ)-5-フルオロピリミジン-4-イル]オキシ}フェニル)-2-(メトキシイミノ)-N-メチルエタンアミド、(2E)-2-{2-[({[(2E,3E)-4-(2,6-ジクロロフェニル)プト-3-エン-2-イリデン]アミノ}オキシ)メチル]フェニル}-2-(メトキシイミノ)-N-メチルエタンアミド、2-クロロ-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド、N-(3-エチル-3,5,5-トリメチルシクロヘキシル)-3-(ホルミルアミノ)-2-ヒドロキシベンズアミド、5-メトキシ-2-メチル-4-(2-{[(1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン}アミノ]オキシ)メチル}フェニル)-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン、(2E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-(2-{[(1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン}アミノ]オキシ)メチル}フェニル)エタンアミド、(2E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-{2-[(E)-({1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エトキシ}イミノ)メチル]フェニル}エタンアミド、(2E)-2-{2-[({[(1E)-1-(3-{[(E)-1-フルオロ-2-フェニルエテニル]オキシ}フェニル)エチリデン]アミノ}オキシ)メチル]フェニル}-2-(メトキシイミノ)-N-メチルエタンアミド、1-(4-クロロフェニル)-2-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)シクロヘプタノール、メチル1-(2,2-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-1H-イミダゾール-5-カルボキシレート、N-エチル-N-メチル-N'-{2-メチル-5-(トリフルオロメチル)-4-[3-(トリメチルシリル)プロボキシ]フェニル}イミドホルムアミド、N'-{5-(ジフルオロメチル)-2-メチル-4-[3-(トリメチルシリル)プロボキシ]フェニル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、O-{1-[(4-メトキシフェノキシ)メチル]-2,2-ジメチルプロピル}1H-イミダゾール-1-カルボチオエート、N-[2-(4-{[3-(4-クロロフェニル)プロブ-2-イン-1-イル]オキシ}-3-メトキシフェニル)エチル]-N2-(メチルスルホニル)バリンアミド、5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン、5-アミノ-1,3,4-チアジアゾール-2-チオール、プロパモカルブ-ホセチル、1-[(4-メトキシフェノキシ)メチル]-2,2-ジメチルプロピル1H-イミダゾール-1-カルボキシレート、1-メチル-N-[2-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ)フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、2,3,5,6-テトラクロロ-4-(メチルスルホニル)ピリジン、2-プトキシ-6-ヨード-3-プロピル-4H-クロメン-4-オン、2-フェニルフェノールおよび塩、3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[2-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[2-(1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロプロボキシ)フェニル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、3,4,5-トリクロロピリジン-2,6-ジカルボニトリル

10

20

30

40

50

、 3 - [5 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 - ジメチルイソオキサゾリジン - 3 - イル] ピリジン、 3 - クロロ - 5 - (4 - クロロフェニル) - 4 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 6 - メチルピリダジン、 4 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 3 , 6 - ジメチルピリダジン、キノリン - 8 - オール、キノリン - 8 - オール硫酸塩 (2 : 1) (塩)、ベンチアゾール、ベトキサジン、カブシマイシン、カルボン、キノメチオネート、クロロネブ、クフラネブ、シフルフェナミド、シモキサニル、シプロスルファミド、ダゾメット、デバカルブ、ジクロロフェン、ジクロメジン、ジクロラン、ジフェンゾコート、ジフェンゾコートメチル硫酸塩、ジフェニルアミン、エコメイト、フェリムゾン、フルメトベル、フルオピコリド、フルオロイミド、フルスルファミド、ホセチル - アルミニウム、ホセチル - カルシウム、ホセチル - ナトリウム、ヘキサクロロベンゼン、イルマイシン、イソチアニル、メタスルホカルブ、メチル (2 E) - 2 - { 2 - [({ シクロプロピル [(4 - メトキシフェニル) イミノ] メチル } チオ) メチル] フェニル } - 3 - メトキシアクリレート、メチルイソチオシアネート、メトラフェノン、 (5 - プロモ - 2 - メトキシ - 4 - メチルピリジン - 3 - イル) (2 , 3 , 4 - トリメトキシ - 6 - メチルフェニル) メタノン、ミルジオマイシン、トルニファニド、N - (4 - クロロベンジル) - 3 - [3 - メトキシ - 4 - (プロブ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、N - [(4 - クロロフェニル) (シアノ) メチル] - 3 - [3 - メトキシ - 4 - (プロブ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、N - [(5 - プロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) メチル] - 2 , 4 - ジクロロピリジン - 3 - カルボキサミド、N - [1 - (5 - プロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) エチル] - 2 , 4 - ジクロロピリジン - 3 - カルボキサミド、N - [1 - (5 - プロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) エチル] - 2 - フルオロ - 4 - ヨードピリジン - 3 - カルボキサミド、N - { (Z) - [(シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 , 3 - ジフルオロフェニル] メチル } - 2 - フェニルアセトアミド、N - { (E) - [(シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 , 3 - ジフルオロフェニル] メチル } - 2 - フェニルアセトアミド、ナタマイシン、ニッケルジメチルジチオカルバメート、ニトロタル - イソプロピル、オクチリノン、オキサモカルブ、オキシフェンチン、ペンタクロロフェノールおよび塩、フェナジン - 1 - カルボン酸、フェノトリン、亜リン酸およびこの塩、プロパモカルブホセチレート、プロパノシン - ナトリウム、プロキナジド、ピロールニトリン、キントゼン、S - プロブ - 2 - イン - 1 - イル 5 - アミノ - 2 - (1 - メチルエチル) - 4 - (2 - メチルフェニル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 1 - カルボチオエート、テクロフタラム、テクナゼン、トリアゾキシド、トリクラミド、5 - クロロ - N ' - フェニル - N ' - プロブ - 2 - イン - 1 - イルチオフェン - 2 - スルホノヒドラジドおよびザリラミドのようなさらなる化合物。

【 0 1 0 6 】

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

【 0 1 0 7 】

式 (I) の化合物および本発明による殺菌剤組成物を使用して、植物または作物の植物病原性菌類を治療的または予防的に防除することができる。

【 0 1 0 8 】

かくして、本発明のさらに別の態様により、植物または作物の植物病原性菌類を治療的または予防的に防除する方法が提供され、ここで、該方法は、式 (I) の化合物または本発明による殺菌剤組成物を、種子、植物もしくは植物の果実に施用する、または、植物が生育している土壌もしくは植物を生育させるのが望ましい土壌に施用することを特徴とする。

10

20

30

40

50

【0109】

本発明による処置方法は、塊茎または根茎のような繁殖材料を処置するのにも有用であり得、さらには、種子、実生または移植実生 (seedlings pricking out) および植物または移植植物 (plants pricking out) を処置するのにも有効であり得る。この処置方法は、根を処置するのにも有効であり得る。本発明による処置方法は、関係している植物の樹幹、茎または柄、葉、花および果実のような植物の地上部を処置するのにも有用であり得る。

【0110】

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

【0111】

本発明による方法で防除可能な植物または作物の病害の中で、以下のものを挙げるができる：

- ・うどんこ病 (powdery mildew disease)、例えば、ブルメリア (Blumeria) 病、例えば、ブルメリア・グラミニス (Blumeria graminis) に起因するもの；
- ポドスファエラ (Podospaera) 病、例えば、ポドスファエラ・レウコトリカ (Podospaera leucotricha) に起因するもの；
- スファエロテカ (Sphaerotheca) 病、例えば、スファエロテカ・フリギネア (Sphaerotheca fuliginea) に起因するもの；
- ウンシヌラ (Uncinula) 病、例えば、ウンシヌラ・ネカトル (Uncinula necator) に起因するもの；
- ・さび病 (rust disease)、例えば、

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

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

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

プッシニア (*Puccinia*) 病、例えば、プッシニア・レコンジタ (*Puccinia recondita*)、プッシニア・グラミニス (*Puccinia graminis*) またはプッシニア・ストリイホルミス (*Puccinia striiformis*) に起因するもの；

10

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

・卵菌類による病害 (*Oomycete disease*)、例えば、アルブゴ (*Albugo*) 病、例えば、アルブゴ・カンジダ (*Albugo candida*) に起因するもの；

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

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

20

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

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

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

30

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

・葉斑点性、葉汚斑性および葉枯れ性の病害 (*leaf spot, leaf blotch and leaf blight disease*)、例えば、

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

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

クラジオスポリウム (*Cladosporium*) 病、例えば、クラジオスポリウム・ククメリナム (*Cladosporium cucumerinum*) に起因するもの；

40

コクリオボルス (*Cochliobolus*) 病、例えば、コクリオボルス・サチブス (*Cochliobolus sativus*) (分生子形態: *Drechslera*、異名: *Helminthosporium*) またはコクリオボルス・ミヤベアヌス (*Cochliobolus miyabeanus*) に起因するもの；

コレトトリクム (*Colletotrichum*) 病、例えば、コレトトリクム・リンデムチアヌム (*Colletotrichum lindemuthianum*) に起因するもの；

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

50

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

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

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

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

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

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

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

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

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

ピレノホラ (*Pyrenophora*) 病、例えば、ピレノホラ・テレス (*Pyrenophora teres*) またはピレノホラ・トリチシ・レベンティス (*Pyrenophora tritici repentis*) に起因するもの；

ラムラリア (*Ramularia*) 病、例えば、ラムラリア・コロ - シグニ (*Ramularia collo - cygni*) またはラムラリア・アレオラ (*Ramularia areola*) に起因するもの；

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

セプトリア (*Septoria*) 病、例えば、セプトリア・アピイ (*Septoria apii*) およびセプトリア・リコペルシシ (*Septoria lycopersi ci*) に起因するもの；

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

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

・根、莖および茎の病害 (root - , sheath and stem disease)、例えば、

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

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

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

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

サロクラジウム (*Sarocladium*) 病、例えば、サロクラジウム・オリゼ (*Sarocladium oryzae*) に起因するもの；

スクレロチウム (*Sclerotium*) 病、例えば、スクレロチウム・オリゼ (*Sc*

10

20

30

40

50

- lerotium oryzae)に起因するもの；
- タペシア(Tapesia)病、例えば、タペシア・アクホルミス(Tapesia aciformis)に起因するもの；
- チエラビオプシス(Thielaviopsis)病、例えば、チエラビオプシス・バシコラ(Thielaviopsis basicola)に起因するもの；
- ・トウモロコシ穂軸を含む穂の病害(ear and panicle disease)、例えば、
- アルテルナリア(Alternaria)病、例えば、アルテルナリア属種(Alternaria spp.)に起因するもの；
- アスペルギルス(Aspergillus)病、例えば、アスペルギルス・フラブス(Aspergillus flavus)に起因するもの； 10
- クラドスポリウム(Cladosporium)病、例えば、クラジオスポリウム・クラドスポリオイデス(Cladosporium cladosporioides)に起因するもの；
- クラビセプス(Claviceps)病、例えば、クラビセプス・プルプレア(Claviceps purpurea)に起因するもの；
- フサリウム(Fusarium)病、例えば、フサリウム・クルモルム(Fusarium culmorum)に起因するもの；
- ジベレラ(Gibberella)病、例えば、ジベレラ・ゼアエ(Gibberella zeae)に起因するもの； 20
- モノグラフェラ(Monographella)病、例えば、モノグラフェラ・ニバリス(Monographella nivalis)に起因するもの；
- ・黒穂病(smut- and bunt disease)、例えば、
- スファセロテカ(Sphacelotheca)病、例えば、スファセロテカ・レイリアナ(Sphacelotheca reiliana)に起因するもの；
- チレチア(Tilletia)病、例えば、チレチア・カリエス(Tilletia caries)に起因するもの；
- ウロシスチス(Urocystis)病、例えば、ウロシスチス・オクルタ(Urocystis occulta)に起因するもの；
- ウスチラゴ(Ustilago)病、例えば、ウスチラゴ・ヌダ(Ustilago nuda)に起因するもの； 30
- ・果実の腐敗性および黴性の病害(fruit rot and mould disease)、例えば、
- アスペルギルス(Aspergillus)病、例えば、アスペルギルス・フラブス(Aspergillus flavus)に起因するもの；
- ボトリチス(Botrytis)病、例えば、ボトリチス・シネレア(Botrytis cinerea)に起因するもの；
- ペニシリウム(Penicillium)病、例えば、ペニシリウム・エクспанスム(Penicillium expansum)およびペニシリウム・プルプロゲナム(Penicillium purpurogenum)に起因するもの； 40
- リゾプス(Rhizopus)病、例えば、リゾプス・ストロニファー(Rhizopus stolonifer)に起因するもの；
- スクレロチニア(Sclerotinia)病、例えば、スクレロチニア・スクレロチオルム(Sclerotinia sclerotiorum)に起因するもの；
- ベルチシリウム(Verticillium)病、例えば、ベルチシリウム・アルボアトルム(Verticillium albo-atrum)に起因するもの；
- ・種子および土壌が媒介する腐朽性、黴性、萎凋性、腐敗性および苗立ち枯れ性の病害(seed- and soilborne decay, mould, wilt, rot and damping-off disease)
- アルテルナリア(Alternaria)病、例えば、アルテルナリア・ブラシキコラ 50

- (*Alternaria brassicicola*) に起因するもの；
 アファノミセス (*Aphanomyces*) 病、例えば、アファノミセス・ユートイケス (*Aphanomyces euteiches*) に起因するもの；
 アスコチタ (*Ascochyta*) 病、例えば、アスコチタ・レンチス (*Ascochyta lentis*) に起因するもの；
 アスペルギルス (*Aspergillus*) 病、例えば、アスペルギルス・フラブス (*Aspergillus flavus*) に起因するもの；
 クラドスポリウム (*Cladosporium*) 病、例えば、クラドスポリウム・ヘルバルム (*Cladosporium herbarum*) に起因するもの；
 コクリオボルス (*Cochliobolus*) 病、例えば、コクリオボルス・サチブス (*Cochliobolus sativus*) に起因するもの；
 (分生子形態：ドレックスレラ (*Drechslera*)、ビポラリス (*Bipolaris*) 別名：ヘルミントスポリウム (*Helminthosporium*))
 コレトトリクム病 (*Colletotrichum*)、例えば、コレトトリクム・コックデス (*Colletotrichum coccodes*) に起因するもの；
 フサリウム (*Fusarium*) 病、例えば、フサリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*) に起因するもの；
 ギベレラ (*Gibberella*) 病、例えば、ギベレラ・ゼエ (*Gibberella zeae*) に起因するもの；
 マクロフォミナ (*Macrophomina*) 病、例えばマクロフォミナ・ファセオリナ (*Macrophomina phaseolina*) に起因するもの；
 ミクロドキウム (*Microdochium*) 病、例えば、ミクロドキウム・ニバレ (*Microdochium nivale*) に起因するもの；
 モノグラフェラ (*Monographella*) 病、例えば、モノグラフェラ・ニバリス (*Monographella nivalis*) に起因するもの；
 ペニシリウム (ペニシリウム) 病、例えば、ペニシリウム・エキスパンスム (*Penicillium expansum*) に起因するもの；
 フォマ (*Phoma*) 病、例えば、フォマ・リングム (*Phoma lingam*) に起因するもの；
 フォモプシス (*Phomopsis*) 病、例えば、フォモプシス・ソジエ (*Phomopsis sojae*) に起因するもの；
 フィトフトラ (*Phytophthora*) 病、例えば、フィトフトラ・カクトルム (*Phytophthora cactorum*) に起因するもの；
 ピレノホラ (*Pyrenophora*) 病、例えば、ピレノホラ・グラミネア (*Pyrenophora graminea*) に起因するもの；
 ピリクラリア (*Pyricularia*) 病、例えば、ピリクラリア・オリゼ (*Pyricularia oryzae*) に起因するもの；
 ピチウム (*Pythium*) 病、例えば、ピチウム・ウルチマム (*Pythium ultimum*) に起因するもの；
 リゾクトニア (*Rhizoctonia*) 病、例えば、リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) に起因するもの；
 リゾプス (*Rhizopus*) 病、例えば、リゾプス・オリゼ (*Rhizopus oryzae*) に起因するもの；
 スクレロチウム (*Sclerotium*) 病、例えば、スクレロチウム・ロルフシイ (*Sclerotium rolfsii*) に起因するもの；
 セプトリア (*Septoria*) 病、例えばセプトリア・ノドルム (*Septoria nodorum*) に起因するもの；
 チフラ (*Typhula*) 病、例えば、チフラ・インカルナタ (*Typhula incarnata*) に起因するもの；
 ベルチシリウム (*Verticillium*) 病、例えば、ベルチシリウム・ダリエ (*Verticillium dahliae*) に起因するもの；

Verticillium dahliae) に起因するもの；

・潰瘍病、てんぐ巣病および枝枯れ病、例えば、

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

・胸枯れ病、例えば、

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

・花および果実の奇形を含めた葉ぶくれ病または葉巻病、例えば、

エキソバシジウム (*Exobasidium*) 病、例えば、エキソバシジウム・ベクス
ンス (*Exobasidium vexans*) に起因するもの；

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

・木質植物の衰退病 (*decline disease*)、例えば、

エスカ病 (*Esca disease*)、例えば、フェオモニエラ・クラミドスポラ (*Phaeomonieella clamydospora*)、フェオアクレモニウム・アレ
オフィルム (*Phaeoacremonium aleophilum*)、ファミチボ
リア・メディテラネア (*Fomitiporia mediterranea*) に起因する
もの；

ガノデルマ (*Ganoderma*) 病、例えば、ガノデルマ・ボニネンセ (*Ganod
erma boninense*) に起因するもの；

・花および種子の病気、例えば、

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

・塊茎の病気、例えば、

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

ヘルミントスポリウム病、例えば、ヘルミントスポリウム・ソラニ (*Helminth
osporium solani*) に起因するもの；

・根こぶ病、例えば、

プラモディオフィラ (*Plamodiophora*) 病、例えば、プラモディオフィラ
・ブラシカエ (*Plamodiophora brassicae*) に起因するもの。

【0112】

・細菌性生物に起因する病気、例えば、

ザントモナス (*Xanthomonas*) 属種、例えば、ザントモナス・キャンペスト
リス・パソパー・オリゼ (*Xanthomonas campestris pv. or
yzae*)；

シュードモナス (*Pseudomonas*) 属種、例えば、シュードモナス・シリング
・パソパー・ラクリマンズ (*Pseudomonas syringae pv. lac
hrymans*)；

エルウィニア (*Erwinia*) 属種、例えば、エルウィニア・アミロポーラ (*Erw
inia amylovora*)。

【0113】

本発明による殺菌剤組成物は、材木の表面または内部で発生するであろう菌類病に対しても使用することができる。用語「材木 (*timber*)」は、すべての種の木、そのような木を建築用に加工したすべてのタイプのもの、例えば、ソリッドウッド、高密度木材、積層木材および合板などを意味する。本発明による材木の処理方法は、主に、本発明による1種もしくは複数の化合物または本発明による組成物を接触させることにより行う。これには、例えば、直接的な塗布、噴霧、浸漬、注入、または、別の適切な任意の手段が包含される。

【0114】

10

20

30

40

50

本発明による処理方法において通常施用される活性化合物の薬量は、茎葉処理における施用では、一般に、また、有利には、10から800 g / ha、好ましくは、50から300 g / haである。種子処理の場合は、活性物質の施用薬量は、一般に、また、有利には、種子100 kg当たり2から200 g、好ましくは、種子100 kg当たり3から150 gである。

【0115】

本明細書で示されている薬量が本発明による方法を例証するための例として挙げられているということは、明確に理解される。当業者は、特に処理対象の植物または作物の性質に応じて、該施用薬量を適合させる方法を理解するであろう。

【0116】

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

【0117】

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

【0118】

本発明の様々な態様について、化合物の例についての下記表および下記調製実施例または効力実施例を参照して説明する。

【0119】

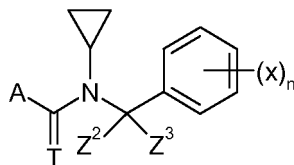
以下の表は、本発明による化合物の例について非限定的に例証している。

【0120】

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

【0121】

【化33】



【0122】

10

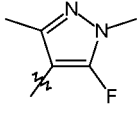
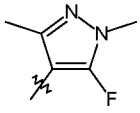
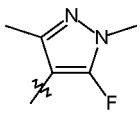
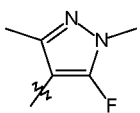
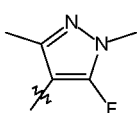
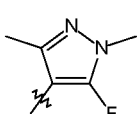
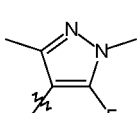
20

30

40

【表 1】

表 1:

実施例番号	A	T	Z ¹	Z ²	Z ³	(X) _n	M+1	LogP
1		S	cPr	H	H	4-(4-Cl-7I/キシ)	430	4,59
2		S	cPr	H	H	2-F-4-(3-Cl-4-F-7I=ll)	450	4,73
3		S	cPr	H	H	2-Cl-3-CF ₃	406	3,92
4		S	cPr	H	H	2,6-Et ₂	360	4,39
5		S	cPr	H	H	4-OPh	396	4,06
6		S	cPr	H	H	2,4,6-Cl ₃	406	4,42
7		S	cPr	H	H	2-SiMe ₃	376	4,64

10

20

30

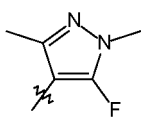
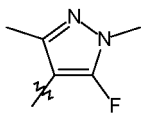
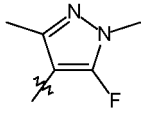
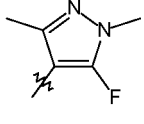
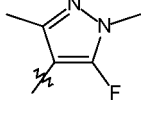
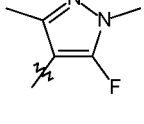
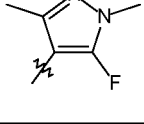
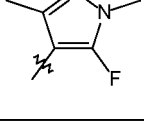
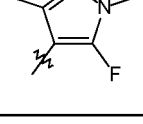
実施例番号	A	T	Z ¹	Z ²	Z ³	(X) _n	M+1	LogP
8		S	cPr	H	H	2-Cl-4-CF ₃	406	4,14
9		S	cPr	H	H	2-Cl-5-CF ₃	406	3,96
10		S	cPr	H	Pr	2,4-Cl ₂	414	4,97
11		S	cPr	H	H	2-cHex	386	5,17
12		S	cPr	H	H	2-I	430	3,68
13		S	cPr	H	H	2,4,6-Br ₃		4,86
14		S	cPr	H	H	2-iPr	346	3,89
15		S	cPr	H	Me	2,4-Cl ₂	386	4,14
16		S	cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Me	386	4,06

10

20

30

40

実施例番号	A	T	Z ¹	Z ²	Z ³	(X) _n	M+1	LogP
17		S	cPr	H	Me	3-OBn	424	4,36
18		S	cPr	H	H	4-(2,4-Cl ₂ -7I/キ)	464	5
19		S	cPr	H	Me	2,5-Cl ₂	386	4,04
20		S	2,2-Me ₂ -cPr	H	H	2-Cl-6-CF ₃	434	
21		S	cPr	H	H	2-CH ₂ SiMe ₃	390	
22		S	cPr	H	H	2-Br-5-Cl	3,99	
23		S	cPr	H	H	2-iBu	360	
24		S	cPr	H	H	2-iPn	374	
25		S	cPr	H	H	2-F-3-Cl-6-CF ₃	424	

10

20

30

40

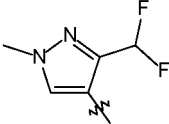
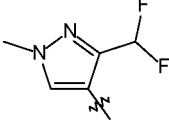
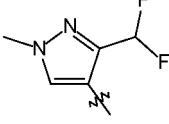
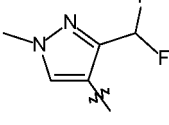
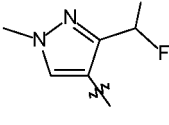
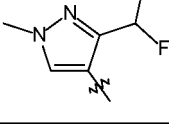
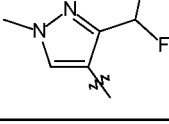
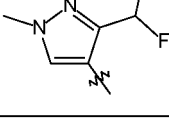
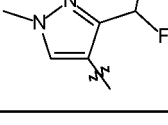
実施例番号	A	T	Z ¹	Z ²	Z ³	(X) _n	M+1	LogP
26		S	2,2-Me ₂ -cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Cl	434	
27		S	cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Cl	406	
28		S	cPr	H	H	2-Cl-4-CF ₃	420	4,54
29		S	cPr	H	H	2-F-3-Cl-6-CF ₃	438	
30		S	cPr	H	H	2,4,6-Cl ₃	420	
31		S	cPr	H	H	2-Br	400	3,46
32		S	cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Me	404	4,01
33		S	cPr	H	H	3-OBn	428	4,06
34		S	cPr	H	H	2-Cl-6-CF ₃	424	3,71

10

20

30

40

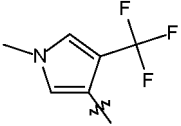
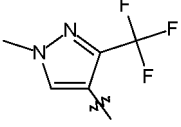
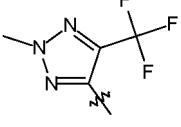
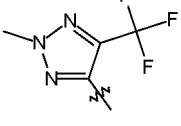
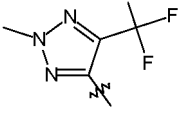
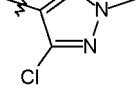
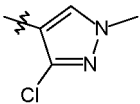
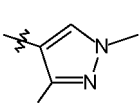
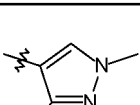
实施例番号	A	T	Z ¹	Z ²	Z ³	(X) _n	M+1	LogP
35		S	cPr	H	H	2-Cl-4-CF ₃	424	4,09
36		S	cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Cl	424	4,01
37		S	cPr	H	H	2-SiMe ₃	394	4,49
38		S	cPr	H	H	H	322	
39		S	cPr	H	H	2,4-Cl ₂	390	
40		S	2,2-Me ₂ -cPr	H	H	2-Cl-6-CF ₃	452	
41		S	2,2-Me ₂ -cPr	H	H	2-I	476	
42		S	cPr	H	H	2-Br-5-Cl	3,89	
43		S	2,2-Me ₂ -cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Cl	452	

10

20

30

40

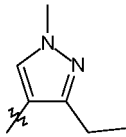
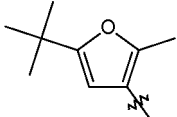
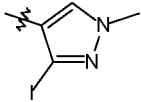
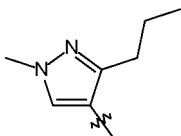
実施例番号	A	T	Z ¹	Z ²	Z ³	(X) _n	M+1	LogP
44		S	cPr	H	H	2-Cl-4,5- メチレンジオキソ	417	4,01
45		S	cPr	H	H	2,6-Cl ₂ -4-OCF ₃	492	4,9
46		S	cPr	H	H	2-Cl-6-CF ₃	443	4,67
47		S	cPr	H	H	2-CF ₃ -5-Cl	443	4,94
48		S	cPr	H	H	2,4-Cl ₂	409	4,95
49		S	cPr	H	Me	3,5-Cl ₂		4,49
50		S	cPr	H	H	2-Cl-6-CF ₃	408	3,83
51		S	cPr	H	H	2-I		3,73
52		S	cPr	H	H	2,4,6-Cl ₃		4,49

10

20

30

40

実施例番号	A	T	Z ¹	Z ²	Z ³	(X) _n	M+1	LogP
53		S	cPr	H	H	2-I	426	3,53
54		S	cPr	H	H	2-I	454	5,95
55		S	cPr	H	H	2,6-Cl ₂		3,71
56		S	cPr	H	Me	2,4-Cl ₂	396	4,39

10

20

【 0 1 2 3 】

下記実施例により、本発明による式 (I) の化合物の調製および効力について非限定的に例証する。

【 0 1 2 4 】

調製実施例：

一般調製実施例：Chem speed装置での式 (I) のアミドの加硫

13 ml の Chem speed バイアルに、0.27 mmol の五硫化リン (P₂S₅) を計量する。ジオキサン中のアミド (I) の 0.18 mol 溶液の 3 ml (0.54 mmol) を添加し、この混合物を、2 時間加熱還流する。次いで、温度を 80 に冷却し、2.5 ml の水を添加する。この混合物を、80 でもう 1 時間加熱する。次いで、2 ml の水を添加し、この反応混合物を、4 ml のジクロロメタンで 2 回抽出する。有機相を塩基性アルミナカートリッジ (2 g) に置き、8 ml のジクロロメタンで 2 回溶離する。溶媒を除去し、粗製チオアミド誘導体を、LCMS および NMR で分析する。十分に純粋ではない化合物を、分取 LCMS でさらに精製する。

30

【 0 1 2 5 】

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

試験する活性成分を、アセトン / tween / 水の混合物中でポッター均質化 (potter homogenization) によって調製する。次いで、この懸濁液を水で希釈して所望の活性物質濃度を得る。

40

【 0 1 2 6 】

スターターカップ中の 50 / 50 の泥炭土 - ポゾラン底土に播種し 18 - 20 で生育したダイコン植物 (品種 Pernot) を、上記に記載された通り調製した活性成分を噴霧することによって子葉期に処理する。

【 0 1 2 7 】

対照として使用される植物は、活性物質を含んでいないアセトン / tween / 水の混合物で処理する。

【 0 1 2 8 】

24 時間後、植物を、アルテルナリア・ブラシカエ胞子の水性懸濁液 (1 cm³ 当たり 40,000 胞子) をこれらに噴霧することによって汚染する。胞子は、12 から 13 日

50

経過した培養物から回収する。

【0129】

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

【0130】

等級付けを、汚染後6から7日に対照植物と比較して実施する。これらの条件下、良好な保護(少なくとも70%)が、以下の化合物:1、3、4、5、6、7、8、9、12、14、16、18、19、21、22、23、24、25、27、29、31、32、33、34、35、36、37、42、43および50で500ppmの薬量で観察されている。

10

【0131】

実施例B:ピレノホラ・テレス(Pyrenophora Teres)(オオムギ網斑病)のインビボ試験

試験する活性成分を、アセトン/tween/DMSOの混合物中で均質化することによって調製し、次いで水で希釈して所望の活性物質濃度を得る。

【0132】

スターターカップ中で50/50の泥炭土-ポゾラン底土に播種し12で生育した大麦植物(品種Express)を、上記に記載された通り調製した活性成分を噴霧することによって1葉期(草丈10cm)に処理する。対照として使用される植物は、活性物質を含んでいないアセトン/tween/DMSO/水の混合物で処理する。

20

【0133】

24時間後、植物を、ピレノホラ・テレス胞子の水性懸濁液(1ml当たり12,000胞子)をこれらに噴霧することによって汚染する。胞子を12日経過の培養物から回収する。汚染された大麦を、約20および相対湿度100%で24時間インキュベートし、次いで相対湿度80%で12日間インキュベートする。

【0134】

等級付けを、対照植物と比較して汚染後12日に実施する。これらの条件下で、良好(少なくとも70%)または完全な保護が、以下の化合物:1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、12、14、15、16、17、18、19、21、22、23、24、25、27、28、29、31、32、33、34、35、36、37、38、39、42、43、44、46、50、51、52、53および55で500ppmの薬量で観察されている。

30

【0135】

実施例C:スファエロテカ・フリギネア(Sphaerotheca fuliginosa)(ウリ類うどんこ病)のインビボ試験

試験する活性成分を、アセトン/tween/水の混合物中で均質化することによって調製する。次いで、この懸濁液を水で希釈して所望の活性物質濃度を得る。

【0136】

50/50の泥炭土-ポゾラン底土に播種し、20/23で生育したスターターカップ中のガーキン植物(品種Vert petit de Paris)を、上記に記載された水性懸濁液を噴霧することによって双葉期(2leaves stage)に処理する。対照として使用される植物は、活性物質を含んでいない水性溶液で処理する。

40

【0137】

24時間後、植物を、スファエロテカ・フリギネア胞子の水性懸濁液(1ml当たり100000胞子)をこれらに噴霧することによって汚染する。胞子を汚染された植物から回収する。汚染されたガーキン植物を、約20/25および相対湿度60/70%でインキュベートする。

【0138】

等級付け(効力%)を、対照植物と比較して汚染後21日に実施する。

【0139】

50

これらの条件下で、良好な（少なくとも70%）または完全な保護が、以下の化合物：3、4、5、6、8、9、10、14、15、16、17、18、19、21、22、23、24、25、28、29、31、32、33、34、35、36、37、38、39、42、43、45、46、47、48、50、51、52、53、55および56で500ppmの薬量で観察されている。

【0140】

実施例D：マイコスファエレラ・グラミニコラ（*Mycosphaerella graminicola*）（小麦斑点病）のインビボ試験

試験する活性成分を、アセトン/tween/DMSOの混合物中で均質化することによって調製し、次いで水で希釈して所望の活性物質濃度を得る。

10

【0141】

スターターカップ中で50/50の泥炭土-ポゾラン底土に播種し、12で生育した小麦植物（品種Scipion）を、上記に記載の通り調製した活性成分を噴霧することによって1葉期（草丈10cm）に処理する。

【0142】

対照として使用される植物は、活性物質を含んでいないアセトン/tween/DMSO/水の混合物で処理する。

【0143】

24時間後、植物を、マイコスファエレラ・グラミニコラ胞子の水性懸濁液（1ml当たり500,000胞子）をこれらに噴霧することによって汚染する。胞子は7日経過の培養物から回収する。汚染された小麦植物を、18および相対湿度100%で72時間インキュベートし、次いで相対湿度90%で21から28日間インキュベートする。

20

【0144】

等級付け（効力%）を、対照植物と比較して汚染後21から28日に実施する。

【0145】

これらの条件下で、良好な（少なくとも70%）または完全な保護が、以下の化合物：1、2、4、6、7、10、11、12、14、16、17、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、31、32、34、36、39、41、42、43、44、46、53、55および56で500ppmの薬量で観察されている。

【0146】

効力実施例E：プッシニア・レコンジタf属種トリチシ（*Puccinia recondita* f. Sp. tritici）（小麦褐さび病）のインビボ試験

試験する活性成分を、アセトン/tween/DMSOの混合物中で均質化することによって調製し、次いで水で希釈して所望の活性物質濃度を得る。

30

【0147】

50/50の泥炭土-ポゾラン底土に播種し、12で生育したスターターカップ中の小麦植物（品種Scipion）を、上記に記載された通りに調製した活性成分を噴霧することによって1葉期（草丈10cm）に処理する。対照として使用される植物は、活性物質を含んでいないアセトン/tween/DMSO/水の混合物で処理する。

【0148】

24時間後、植物を、プッシニア・レコンジタ胞子の水性懸濁液（1ml当たり100,000胞子）を葉に噴霧することによって汚染する。胞子は、10日経過の汚染された小麦から回収し、2.5ml/lのtween80の10%を含む水中に懸濁する。汚染された小麦植物を、20および相対湿度100%で24時間インキュベートし、次いで20および相対湿度70%で10日間インキュベートする。等級付けを、対照植物と比較して汚染後10日に実施する。

40

【0149】

これらの条件下で、良好な（少なくとも70%）または完全な保護が、以下の化合物：3、4、5、6、7、8、9、12、14、16、17、21、22、23、24、25、27、29、32、34、36、37、38、42、50、51および52で500p

50

p mの薬量で観察されている。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	
A 0 1 N 43/08	(2006.01)	A 0 1 N 43/08	F
A 0 1 P 3/00	(2006.01)	A 0 1 P 3/00	
C 0 7 D 249/04	(2006.01)	C 0 7 D 249/04	
A 0 1 N 43/647	(2006.01)	A 0 1 N 43/647	

- (72)発明者 ガリー, ステファニー
フランス国、エフ - 6 9 4 1 0 ・ シャンパーニュ・オ・モン・ドール、リュ・シモン・ピユイツ
ン・9
- (72)発明者 グロジャン - クールノワイエ, マリ - クレール
フランス国、エフ - 6 9 2 5 0 ・ キュリ・ゾ・モン・ドール、ルート・ダルビニー、ル・トレブ
・コロンジユ
- (72)発明者 アルトマン, ブノワ
フランス国、エフ - 6 9 1 1 0 ・ サント・ホワイ・レ・リヨン、リュ・ドユ・コマンダン・シャル
コ・1 1 3 ・ ビス
- (72)発明者 リノルファイ, フィリップ
フランス国、エフ - 6 9 3 8 0 ・ シヤテイヨン・ダゼルグ、リュ・デイ・ラ・コルテイエール、レ
ジデンス・ル・コトー
- (72)発明者 ボール, ジャン - ピエール
フランス国、エフ - 6 9 1 1 0 ・ サント・ホワイ・レ・リヨン、アレ・アダンソン・6

審査官 太田 千香子

- (56)参考文献 特開平09 - 176125 (JP, A)
特許第4879973 (JP, B2)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

A 0 1 N 4 3 / 0 8
A 0 1 N 4 3 / 3 6
A 0 1 N 4 3 / 5 6
A 0 1 N 4 3 / 6 4 7
C A p l u s (S T N)
R E G I S T R Y (S T N)