

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2015-502933

(P2015-502933A)

(43) 公表日 平成27年1月29日(2015.1.29)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
CO7D 263/32 (2006.01)	CO7D 263/32 CSP	4CO33
CO7D 277/20 (2006.01)	CO7D 277/32	4CO48
CO7D 277/32 (2006.01)	AO1N 43/78 A	4CO56
AO1N 43/78 (2006.01)	AO1N 43/76	4HO06
AO1N 43/76 (2006.01)	AO1P 3/00	4HO11
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求		(全 73 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2014-542840 (P2014-542840)	(71) 出願人	512151078
(86) (22) 出願日	平成24年11月23日 (2012.11.23)		バイエル・インテレクチュアル・プロパテ
(85) 翻訳文提出日	平成26年7月18日 (2014.7.18)		イー・ゲー・エム・ペー・ハー
(86) 国際出願番号	PCT/EP2012/073426		ドイツ国、40789・モンハイム、アル
(87) 国際公開番号	W02013/076227		フレートーノベルーシュトラーセ・10
(87) 国際公開日	平成25年5月30日 (2013.5.30)	(74) 代理人	100114188
(31) 優先権主張番号	11190684.8		弁理士 小野 誠
(32) 優先日	平成23年11月25日 (2011.11.25)	(74) 代理人	100119253
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)		弁理士 金山 賢教
		(74) 代理人	100124855
			弁理士 坪倉 道明
		(74) 代理人	100129713
			弁理士 重森 一輝
		(74) 代理人	100137213
			弁理士 安藤 健司
最終頁に続く			

(54) 【発明の名称】 新規な複素環アルカノール誘導体

(57) 【要約】

本発明は、新規な複素環アルカノール誘導体、当該化合物の製造方法、当該化合物を含む薬剤、ならびに特に材料保護における有害生物管理での破壊的微生物防除のための生理活性化化合物としての、そして植物成長調節剤としてのそれらの使用に関するものである。

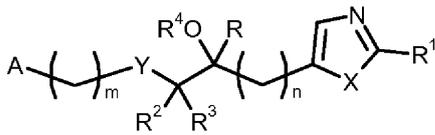
【選択図】なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式 (I) の複素環アルカノール誘導体およびそれらの農薬活性な塩。

【化 1】



(I)

[式中、

X は、O または S を表し、

Y は、O、S、SO、SO₂、-CH₂- または直接結合を表し、

m は、0 または 1 を表し、

n は、0 または 1 を表し、

R は、各場合で置換されていても良いアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルまたはアリールを表し、

R¹ は、水素、SH、アルキルチオ、アルコキシ、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルキルチオ、ハロアルコキシ、シアノ、ニトロまたは Si (アルキル)₃ を表し、

R² は、水素または置換されていても良いアルキルを表し、

R³ は、水素、ハロゲンまたは置換されていても良いアルキルを表し、

R⁴ は、水素、置換されていても良いアルキルカルボニル、アルキル、ホルミルまたはトリアルキルシリルを表し、

R² および R³ が一緒に、置換されていても良い C₂ - C₅ - アルキレンをさらに表すことができ、

R および R² が一緒に、置換されていても良い C₂ - C₅ - アルキレンをさらに表すことができ、

R および R⁴ が一緒に、各場合でハロゲン -、アルキル - またはハロアルキル置換されていても良い C₁ - C₄ - アルキレンまたは C₁ - C₄ - アルキレンオキシをさらに表すことができ、この基の酸素が R と一体となって、置換されていても良いテトラヒドロフラン - 2 - イル、1, 3 - ジオキセタン - 2 - イル、1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル、1, 3 - ジオキサン - 2 - イルまたは 1, 3 - ジオキセパン - 2 - イル環を形成しており、

R⁴ および R² はさらに、直接結合を表していても良く、

m が 1 を表す場合、Y および R³ が一緒に二重結合をさらに表すことができ、

A は、置換されていても良いアリールまたは置換されていても良いヘテロアリールを表す。]

【請求項 2】

X が、O または S を表し、

Y が、O、S、SO、SO₂、-CH₂- または直接結合を表し、

m が、0 または 1 を表し、

n は、0 または 1 を表し、

R が、各場合で分岐していても良い C₁ - C₇ - アルキル、C₁ - C₈ - ハロアルキル、C₂ - C₇ - アルケニル、C₂ - C₇ - ハロアルケニル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₃ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ - C₁ - C₃ - アルキル、トリ (C₁ - C₃ - アルキル) シリル - C₁ - C₃ - アルキル、各場合でハロゲン -、C₁ - C₄ - アルキル -、C₁ - C₄ - ハロアルキル -、C₁ - C₄ - アルコキシ -、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ -、C₁ - C₄ - ハロアルキルチオ -、C₁ - C₄ - アルキルチオ - またはフェノキシ - 置換されていても良い (フェノキシは、ハロゲンまたは C₁ - C₄ - アルキルによって置換されていても良い。) C₃ - C₇ - シクロアルキルまたは C₃ - C₇ - シクロアルキル - C₁ - C₃ - アルキル (いずれの置換もシクロアルキル部分でのものである。) および各場合でモノないしトリ - ハロゲン - もしくは - C₁ - C₄ - アルキル -

10

20

30

40

50

置換されていても良いフェニルを表し、

R^1 が、水素、SH、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -アルコキシまたはハロゲンを表し、

R^2 が、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 $C_1 - C_4$ -アルキルまたは $C_1 - C_4$ -ハロアルキルを表し、

R^3 が、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 $C_1 - C_4$ -アルキルまたは $C_1 - C_4$ -ハロアルキルを表し、

R^4 が、水素、($C_1 - C_3$ -アルキル)カルボニル、 $C_1 - C_3$ -アルキル、ホルミル、($C_1 - C_3$ -ハロアルキル)カルボニルまたはトリ($C_1 - C_3$ -アルキル)シリルを表し、

R^2 および R^3 が一緒に、直鎖もしくは分岐およびハロゲン -、特にフッ素 -、塩素 - または臭素 - 置換されていても良い $C_2 - C_5$ -アルキレンをさらに表すことができ、

R および R^2 が一緒に、直鎖もしくは分岐およびハロゲン - もしくは $C_1 - C_4$ -アルキル -、特にフッ素 -、塩素 -、臭素 - またはメチル - 置換されていても良い $C_2 - C_5$ -アルキレンをさらに表すことができ、

R および R^4 が一緒にさらに、フッ素 -、塩素 -、臭素 -、 $C_1 - C_4$ -アルキル - もしくは $C_1 - C_4$ -ハロアルキル - 置換されていても良い - (CH_2)₃ -、- CH_2O -、- (CH_2)₂O -、- (CH_2)₃O - を表し、この基の酸素は各場合で R に結合していることで、置換されていても良いテトラヒドロフラン - 2 - イル、1, 3 - ジオキセタン - 2 - イル、1, 3 - ジオキサラン - 2 - イルまたは 1, 3 - ジオキサン - 2 - イル環が形成されており、

R^4 および R^2 がさらに、直接結合を表すことができ、

m が 1 を表す場合、 Y および R^3 が一緒に二重結合をさらに表すことができ、

A が、置換されていないかモノないトリ - Z^1 - 置換されたフェニルを表し、

Z^1 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、OH、SH、C (アルキル) (=NOアルキル)、 $C_3 - C_7$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル - $C_1 - C_2$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルチオ、 $C_2 - C_4$ -アルケニル、 $C_2 - C_4$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ -アルキニル、 $C_2 - C_4$ -ハロアルキニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホニルオキシ、ホルミル、 $C_2 - C_5$ -アルキルカルボニル、 $C_2 - C_5$ -ハロアルキルカルボニル、 $C_2 - C_5$ -アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_5$ -ハロアルコキシカルボニル、 $C_3 - C_6$ -アルケニルオキシ、 $C_3 - C_6$ -アルキニルオキシ、 $C_2 - C_5$ -アルキルカルボニルオキシ、 $C_2 - C_5$ -ハロアルキルカルボニルオキシ、トリアルキルシリルを表し、または各場合でハロゲン -、 $C_1 - C_4$ -アルキル -、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル -、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ - もしくは $C_2 - C_4$ -アルキルカルボニル - モノ置換されていても良いフェニル、フェノキシまたはフェニルチオを表し、

または

A が、置換されていないかモノないトリ - Z^1 - 置換された 1 - ナフチルを表し、

Z^1 が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、OH、SH、C (アルキル) (=NOアルキル)、 $C_3 - C_7$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル - $C_1 - C_2$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルチオ、 $C_2 - C_4$ -アルケニル、 $C_2 - C_4$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ -アルキニル、 $C_2 - C_4$ -ハロアルキニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホニルオキシ、ホルミル、 $C_2 - C_5$ -アルキルカルボニル、 $C_2 - C_5$ -ハロアルキルカルボニル、 $C_2 - C_5$ -アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_5$

10

20

30

40

50

- ハロアルコキシカルボニル、 $C_3 - C_6$ -アルケニルオキシ、 $C_3 - C_6$ -アルキニルオキシ、 $C_2 - C_5$ -アルキルカルボニルオキシ、 $C_2 - C_5$ -ハロアルキルカルボニルオキシ、トリアルキルシリルを表し、または各場合でハロゲン-、 $C_1 - C_4$ -アルキル-、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル-、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ-もしくは $C_2 - C_4$ -アルキルカルボニル-モノ置換されていても良いフェニル、フェノキシまたはフェニルチオを表し、

または

A が、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニルおよびトリアジニルから選択される各場合でモノ-もしくはポリ- Z^2 -置換されていても良い5員もしくは6員ヘテロアリアルを表し、

Z^2 が、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_3 - C_7$ -シクロアルキルまたは各場合でハロゲン-もしくは $C_1 - C_4$ -アルキル-置換されていても良いフェニル、フェノキシまたはフェニルチオを表す請求項1に記載の式(I)の複素環アルカノール誘導体。

【請求項3】

請求項1または2に記載の式(I)の複素環アルカノール誘導体を植物病原性有害真菌および/またはその生息場所に施用する、植物病原性有害真菌の防除方法。

【請求項4】

増量剤および/または界面活性剤に加えて、少なくとも一つの請求項1または2に記載の式(I)の複素環アルカノール誘導体を含む、植物病原性有害真菌を防除するための組成物。

【請求項5】

植物病原性有害真菌を防除するための請求項1または2に記載の式(I)の複素環アルカノール誘導体の使用。

【請求項6】

植物成長調節剤としての請求項1または2に記載の式(I)の複素環アルカノール誘導体の使用。

【請求項7】

請求項1または2に記載の式(I)の複素環アルカノール誘導体を増量剤および/または界面活性剤と混合する、植物病原性有害真菌を防除するための組成物の製造方法。

【請求項8】

トランスジェニック植物を処理するための、請求項1に記載の式(I)の複素環アルカノール誘導体の使用。

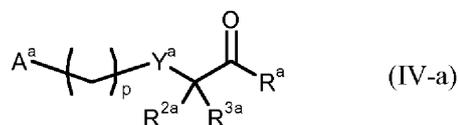
【請求項9】

種子およびトランスジェニック植物の種子を処理するための、請求項1に記載の式(I)の複素環アルカノール誘導体の使用。

【請求項10】

下記式(IV-a)のケトン。

【化2】



[式中、

Y^a は、O、S、SOまたは SO_2 を表し、

p は、0または1を表し、

R^a は、各場合で置換されていても良いアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロア

10

20

30

40

50

ルキルまたはアリールを表し、

R^{2a} は、ハロゲンまたは置換されていても良いアルキルを表し、

R^{3a} は、水素、ハロゲンまたは置換されていても良いアルキルを表し、

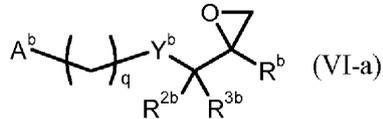
R^{2a} および R^{3a} が一緒に、置換されていても良い $C_2 - C_5$ - アルキレンをさらに表すことができ、

A^a は、置換されていても良いアリールまたは置換されていても良いヘテロアリールを表す。]

【請求項 11】

下記式 (VI-a) のオキシラン誘導体。

【化 3】



[式中、

Y^b は、O、S、SO または SO_2 を表し、

q は、0 または 1 を表し、

R^b は、各場合で置換されていても良いアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルまたはアリールを表し、

R^{2b} は、ハロゲンまたは置換されていても良いアルキルを表し、

R^{3b} は、水素、ハロゲンまたは置換されていても良いアルキルを表し、

R^{2b} および R^{3b} が一緒に、置換されていても良い $C_2 - C_5$ - アルキレンをさらに表すことができ、

A^b は、置換されていても良いアリールまたは置換されていても良いヘテロアリールを表す。]

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規な複素環アルカノール誘導体、これら化合物の製造方法、これら化合物を含む組成物および特に作物保護および材料保護での有害微生物を防除する上での生理活性化合物としての、さらには植物成長調節剤としてのそれらの使用に関する。

【背景技術】

【0002】

特定の複素環アルカノール誘導体を殺菌剤および/または成長調節剤として作物保護で使用可能であることがすでに知られている (EP-A 0395175、EP-A 0409418 参照)。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献 1】EP-A 0395175

【特許文献 2】EP-A 0409418

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

現代の活性化合物、例えば殺菌剤に対する生態的要求および経済的要求は、例えば活性スペクトラム、毒性、選択性、施用量、残留物生成および好ましい製造に関して常に高まっておりさらには例えば抵抗性について問題が生じ得ることから、少なくとも一部の領域で、公知のものに勝る利点を有する新規な殺菌剤組成物を開発することが常に必要とされている。

【課題を解決するための手段】

10

20

30

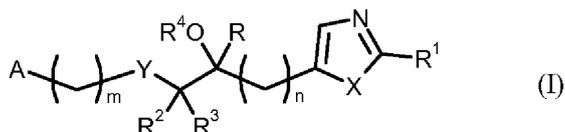
40

50

【0005】

そこで本発明は、下記式(I)の新規な複素環アルカノール誘導体およびそれらの農薬活性な塩を提供する。

【化1】



【0006】

10

式中、

Xは、OまたはSを表し、

Yは、O、S、SO、SO₂、-CH₂-または直接結合を表し、

mは、0または1を表し、

nは、0または1を表し、

Rは、各場合で置換されていても良いアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルまたはアリアルを表し、

R¹は、水素、SH、アルキルチオ、アルコキシ、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルキルチオ、ハロアルコキシ、シアノ、ニトロまたはSi(アルキル)₃を表し、

R²は、水素または置換されていても良いアルキルを表し、

20

R³は、水素、ハロゲンまたは置換されていても良いアルキルを表し、

R⁴は、水素、置換されていても良いアルキルカルボニル、アルキル、ホルミルまたはトリアルキルシリルを表し、

R²およびR³と一緒に、置換されていても良いC₂-C₅-アルキレンをさらに表すことができ、

RおよびR²と一緒に、置換されていても良いC₂-C₅-アルキレンをさらに表すことができ、

RおよびR⁴と一緒に、各場合でハロゲン-、アルキル-またはハロアルキル置換されていても良いC₁-C₄-アルキレンまたはC₁-C₄-アルキレンオキシをさらに表すことができ、この基の酸素がRと一体となって、置換されていても良いテトラヒドロフラン-2-イル、1,3-ジオキセタン-2-イル、1,3-ジオキサラン-2-イル、1,3-ジオキサン-2-イルまたは1,3-ジオキセパン-2-イル環を形成しており、

30

R⁴およびR²はさらに、直接結合を表していても良く、

mが1を表す場合、YおよびR³と一緒に二重結合をさらに表すことができ、

Aは、置換されていても良いアリアルまたは置換されていても良いヘテロアリアルを表す。

【0007】

得ることができる塩も同様に、殺菌特性および/または植物成長調節剤特性を有する。

【0008】

本発明に従って用いることができる複素環アルカノール誘導体は、式(I)によって概括的に定義される。上記および下記において言及される式についての好ましい基の定義を以下に示す。これらの定義は、式(I)の最終生成物および同様に全ての中間体に当てはまるものである(「方法および中間体の説明」の項で下記も参照する。)

40

【0009】

Xは好ましくは、Sを表す。

【0010】

Xは同様に好ましくは、Oを表す。

【0011】

Yは好ましくは、Oを表す。

【0012】

50

Yは同様に好ましくは、 $-CH_2-$ を表す。

【0013】

Yは同様に好ましくは、直接結合を表す。

【0014】

Yは同様に好ましくは、Sまたは SO_2 を表す。

【0015】

Yは特に好ましくは、酸素を表す。

【0016】

Yは同様に特に好ましくは、 $-CH_2-$ を表す。

【0017】

Yは特に好ましくは、直接結合を表す。

【0018】

mは好ましくは、0を表す。

【0019】

mは同様に好ましくは、1を表す。

【0020】

nは好ましくは、0を表す。

【0021】

nは同様に好ましくは、1を表す。

【0022】

Rは好ましくは、各場合で分岐していても良い $C_1 - C_7$ -アルキル、 $C_1 - C_8$ -ハロアルキル、 $C_2 - C_7$ -アルケニル、 $C_2 - C_7$ -ハロアルケニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ- $C_1 - C_3$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ- $C_1 - C_3$ -アルキル、トリ($C_1 - C_3$ -アルキル)シリル- $C_1 - C_3$ -アルキル、各場合でハロゲン-、 $C_1 - C_4$ -アルキル-、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル-、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ-、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ-、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルチオ-、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ-またはフェノキシ置換されていても良い(フェノキシは、ハロゲンまたは $C_1 - C_4$ -アルキルによって置換されていても良い。) $C_3 - C_7$ -シクロアルキルまたは $C_3 - C_7$ -シクロアルキル- $C_1 - C_3$ -アルキル(いずれの置換もシクロアルキル部分上である。)、および各場合でモノないしトリ-ハロゲン-または- $C_1 - C_4$ -アルキル置換されていても良いフェニルを表し、

Rは特に好ましくは、各場合で分岐していても良い $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_5$ -アルケニル、 $C_3 - C_5$ -ハロアルケニル、 $C_1 - C_3$ -アルコキシ- $C_1 - C_2$ -アルキル、 $C_1 - C_3$ -ハロアルコキシ- $C_1 - C_2$ -アルキル、トリ($C_1 - C_2$ -アルキル)シリル- $C_1 - C_2$ -アルキル、各場合でハロゲン-、 $C_1 - C_4$ -アルキル-、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル-、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ-、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ-、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルチオ-、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ-またはフェノキシ置換されていても良い(フェノキシは、フッ素、塩素、臭素または $C_1 - C_4$ -アルキルによって置換されていても良い。) $C_3 - C_6$ -シクロアルキルまたは $C_3 - C_6$ -シクロアルキル- $C_1 - C_2$ -アルキル(いずれの置換もシクロアルキル部分でのものである。)、およびモノないしジ-ハロゲン-または- $C_1 - C_4$ -アルキル置換されていても良いフェニルを表す。

【0023】

Rは非常に特に好ましくは、メチル、エチル、プロピル、tert-ブチル、イソプロピル、1,1,2,2-テトラフルオロエトキシメチル、トリメチルシリルメチル、1-クロロシクロプロピル、1-フルオロシクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、1-メトキシシクロプロピル、1-メチルチオシクロプロピル、1-トリフルオロメチルシクロプロピル、1-フェノキシシクロプロピル、1-(2-クロロフェノキシ)シクロプロピル、1-(2-フルオロフェノキシ)シクロプロピル、1-(4-フルオロフェノキシ)シクロプロピル、1-(2,4-ジフルオロフェノキシ)シクロプロピル、(3E)-

10

20

30

40

50

4 - クロロ - 2 - メチルプト - 3 - エン - 2 - イル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、シクロプロピルメチル、1 - シクロプロピルエチル、2 - シクロプロピルエチル、4 - フルオロフェニル、4 - クロロフェニル、4 - プロモフェニル、4 - ヨードフェニル、4 - メチルフェニルを表す。

【0024】

R^1 は好ましくは、水素、SH、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ - アルコキシまたはハロゲンを表す。

【0025】

R^1 は特に好ましくは、水素、SH、メチルチオ、エチルチオ、メトキシ、エトキシ、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を表す。

10

【0026】

R^2 は好ましくは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 $C_1 - C_4$ - アルキルまたは $C_1 - C_4$ - ハロアルキルを表す。

【0027】

R^2 は特に好ましくは、フッ素、塩素、メチル、エチルまたはトリフルオロメチルを表す。

【0028】

R^2 は非常に特に好ましくは、メチルを表す。

【0029】

R^3 は好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、 $C_1 - C_4$ - アルキルまたは $C_1 - C_4$ - ハロアルキルを表す。

20

【0030】

R^3 は特に好ましくは、水素、フッ素、塩素、メチル、エチルまたはトリフルオロメチルを表す。

【0031】

R^3 は非常に特に好ましくは、水素またはメチルを表す。

【0032】

R^4 は好ましくは、水素、($C_1 - C_3$ - アルキル)カルボニル、 $C_1 - C_3$ - アルキル、ホルミル、($C_1 - C_3$ - ハロアルキル)カルボニルまたはトリ($C_1 - C_3$ - アルキル)シリルを表す。

30

【0033】

R^4 は特に好ましくは、水素、メチルカルボニルまたはトリメチルシリルを表す。

【0034】

R^4 は非常に特に好ましくは、水素を表す。

【0035】

R^2 および R^3 が一体となって、さらに好ましくは直鎖もしくは分岐のおよびハロゲン - 、特にフッ素 - 、塩素 - もしくは臭素置換されていても良い $C_2 - C_5$ - アルキレンを表す。

【0036】

R^2 および R^3 が一体となって、さらに特に好ましくは - (CH_2)₂ - 、 - (CH_2)₄ - 、 - (CH_2)₅ - または - (CH_2) $CH(CH_3)$ - を表す。

40

【0037】

R^2 および R^3 が一体となって、さらに非常に特に好ましくは - (CH_2)₂ - を表す。

【0038】

R および R^2 が一体となって、さらに好ましくは直鎖もしくは分岐のおよびハロゲン - もしくは $C_1 - C_3$ - アルキル - 、特にフッ素 - 、塩素 - 、臭素 - またはメチル置換されていても良い $C_2 - C_5$ - アルキレンを表す。

【0039】

R および R^2 が一体となって、さらに特に好ましくは - (CH_2)₂ - 、 - (CH_2)

50

$4 - 、 - (CH_2)_5 - 、 - (CH_2)_2 C(CH_3)_2 - 、 - C(CH_3)_2 (CH_2)_2 -$ または $- (CH_2)CH(CH_3) -$ を表す。

【0040】

R および R^2 が一体となって、さらに非常に特に好ましくは $- (CH_2)_2 -$ を表す。

【0041】

R および R^4 が一体となって、さらに好ましくはフッ素 -、塩素 -、臭素 -、 $C_1 - C_4$ - アルキル - または $C_1 - C_4$ - ハロアルキル - 置換されていても良い $- (CH_2)_3 - 、 - CH_2O - 、 - (CH_2)_2O - 、 - (CH_2)_3O -$ を表し、この基の酸素は各場合で R に結合していることで、置換されていても良いテトラヒドロフラン - 2 - イル、1, 3 - ジオキセタン - 2 - イル、1, 3 - ジオキソラン - 2 - イルまたは 1, 3 - ジオキサン - 2 - イル環が形成されている。

10

【0042】

R および R^4 が一体となって、さらに特に好ましくはメチル -、エチル -、n - プロピル -、n - ブチル置換されていても良い $- (CH_2)_2O -$ を表し、この基の酸素は R に結合していることで、置換されていても良い 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イルを形成している。

【0043】

R^4 および R^2 が一体となって同様に、好ましくは直接結合を表す。

【0044】

A は好ましくは、置換されていないかモノないトリ - Z^1 - 置換されたフェニルを表し、

20

Z^1 は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、OH、SH、C (アルキル) (=NOアルキル)、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル - $C_1 - C_2$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルチオ、 $C_2 - C_4$ - アルケニル、 $C_2 - C_4$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ - アルキニル、 $C_2 - C_4$ - ハロアルキニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニルオキシ、ホルミル、 $C_2 - C_5$ - アルキルカルボニル、 $C_2 - C_5$ - ハロアルキルカルボニル、 $C_2 - C_5$ - アルコキシカルボニル、 $C_2 - C_5$ - ハロアルコキシカルボニル、 $C_3 - C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_3 - C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_2 - C_5$ - アルキルカルボニルオキシ、 $C_2 - C_5$ - ハロアルキルカルボニルオキシ、トリアルキルシリルを表し、または各場合でハロゲン -、 $C_1 - C_4$ - アルキル -、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル -、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ - または $C_2 - C_4$ - アルキルカルボニル - モノ置換されていても良いフェニル、フェノキシまたはフェニルチオを表す。

30

【0045】

A は特に好ましくは、置換されていないかモノないトリ - Z^1 - 置換されたフェニルを表し、

Z^1 は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C ($C_1 - C_5$ - アルキル) (=NO ($C_1 - C_5$ - アルキル))、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルチオ、 $C_2 - C_4$ - アルケニル、 $C_2 - C_4$ - アルキニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル、 $C_2 - C_5$ - アルキルカルボニル、 $C_2 - C_5$ - アルコキシカルボニル、 $C_3 - C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_3 - C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_2 - C_5$ - アルキルカルボニルオキシを表し、または各場合でハロゲン -、 $C_1 - C_4$ - アルキル -、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル -、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ - または $C_2 - C_4$ - アルキルカルボニル - モノ置換されていても良いフェニル、フェノキシまたはフェニルチオを表す。

40

【0046】

50

A は非常に特に好ましくは、置換されていないかモノないしトリ - Z¹ - 置換されたフェニルを表し、

Z¹ は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C (C₁ - C₄ - アルキル) (= NO (C₁ - C₄ - アルキル))、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₂ - ハロアルキル、C₁ - C₂ - アルコキシ、C₁ - C₂ - ハロアルコキシ、C₁ - C₂ - アルキルチオ、C₁ - C₂ - ハロアルキルチオ、C₁ - C₂ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₂ - アルキルスルホニル、アセチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルカルボニルオキシ、または各場合でハロゲン -、C₁ - C₂ - アルキル -、C₁ - C₂ - ハロアルキル -、C₁ - C₂ - アルコキシ -、アセチル - モノ置換されていても良いフェニル、フェノキシまたはフェニルチオを表す。

10

【0047】

A は特別に好ましくは、置換されていないかモノないしトリ - Z¹ - 置換されたフェニルを表し、

Z¹ は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、CH (= NOMe)、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n -、i -、s - もしくは t - ブチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、ジフルオロクロロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、または各場合でフッ素 -、塩素 -、臭素 -、ヨウ素 -、メチル -、エチル -、トリフルオロメチル -、トリクロロメチル -、ジフルオロメチル -、ジクロロメチル -、ジフルオロクロロメチル -、メトキシ -、アセチル - モノ置換されていても良いフェニル、フェノキシまたはフェニルチオを表す。

20

【0048】

A は同様に好ましくは、置換されていないかモノないしトリ - Z¹ - 置換された 1 - ナフチルを表し、

Z¹ は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、OH、SH、C (アルキル) (= NOアルキル)、C₃ - C₇ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、C₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - ハロアルケニル、C₂ - C₄ - アルキニル、C₂ - C₄ - ハロアルキニル、C₁ - C₄ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルフィニル、C₁ - C₄ - アルキルスルホニル、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルホニル、C₁ - C₄ - アルキルスルホニルオキシ、ホルミル、C₂ - C₅ - アルキルカルボニル、C₂ - C₅ - ハロアルキルカルボニル、C₂ - C₅ - アルコキシカルボニル、C₂ - C₅ - ハロアルコキシカルボニル、C₃ - C₆ - アルケニルオキシ、C₃ - C₆ - アルキニルオキシ、C₂ - C₅ - アルキルカルボニルオキシ、C₂ - C₅ - ハロアルキルカルボニルオキシ、トリアルキルシリルを表し、または各場合でハロゲン -、C₁ - C₄ - アルキル -、C₁ - C₄ - ハロアルキル -、C₁ - C₄ - アルコキシ - または C₂ - C₄ - アルキルカルボニル - モノ置換されていても良いフェニル、フェノキシまたはフェニルチオを表す。

30

40

【0049】

A は同様に好ましくは、置換されていないかモノないしトリ - Z¹ - 置換された 2 - ナフチルを表し、

Z¹ は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、OH、SH、C (アルキル) (= NOアルキル)、C₃ - C₇ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、C₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - ハロアルケニル、C₂ - C₄ - アルキニル、C₂ - C₄ - ハロアルキニル、C₁ - C₄ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルフィニル、C₁ - C₄ - アルキルスルホニル、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルホニル、

50

C₁ - C₄ - アルキルスルホニルオキシ、ホルミル、C₂ - C₅ - アルキルカルボニル、C₂ - C₅ - ハロアルキルカルボニル、C₂ - C₅ - アルコキシカルボニル、C₂ - C₅ - ハロアルコキシカルボニル、C₃ - C₆ - アルケニルオキシ、C₃ - C₆ - アルキニルオキシ、C₂ - C₅ - アルキルカルボニルオキシ、C₂ - C₅ - ハロアルキルカルボニルオキシ、トリアルキルシリルを表し、または各場合でハロゲン -、C₁ - C₄ - アルキル -、C₁ - C₄ - ハロアルキル -、C₁ - C₄ - アルコキシ - または C₂ - C₄ - アルキルカルボニル - モノ置換されていても良いフェニル、フェノキシまたはフェニルチオを表す。

【0050】

Aは同様に好ましくは、各場合でフリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニルおよびトリアジニルから選択されるモノ - またはポリ - Z² - 置換されていても良い5員もしくは6員ヘテロアリアルを表し、

Z²は、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキルチオ、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₃ - C₇ - シクロアルキルまたは各場合でハロゲン - または C₁ - C₄ - アルキル - 置換されていても良いフェニル、フェノキシもしくはフェニルチオを表す。

【0051】

Aは同様に特に好ましくは、各場合で2 - フリル、3 - フリル、2 - チエニル、3 - チエニル、2 - ピロリル、3 - ピロリル、1 - ピロリル、3 - ピラゾリル、4 - ピラゾリル、5 - ピラゾリル、1 - ピラゾリル、1H - イミダゾール - 2 - イル、1H - イミダゾール - 4 - イル、1H - イミダゾール - 5 - イル、1H - イミダゾール - 1 - イル、2 - オキサゾリル、4 - オキサゾリル、5 - オキサゾリル、2 - チアゾリル、4 - チアゾリル、5 - チアゾリル、3 - イソオキサゾリル、4 - イソオキサゾリル、5 - イソオキサゾリル、3 - イソチアゾリル、4 - イソチアゾリル、5 - イソチアゾリル、1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル、1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - イル、1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル、2H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 2 - イル、2H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - イル、1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル、1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イル、1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル、4H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル、4H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 4 - イル、1H - テトラゾール - 1 - イル、1H - テトラゾール - 5 - イル、2H - テトラゾール - 2 - イル、2H - テトラゾール - 5 - イル、1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル、1, 2, 4 - オキサジアゾール - 5 - イル、1, 2, 4 - チアジアゾール - 3 - イル、1, 2, 4 - チアジアゾール - 5 - イル、1, 3, 4 - オキサジアゾール - 2 - イル、1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル、1, 2, 3 - オキサジアゾール - 4 - イル、1, 2, 3 - オキサジアゾール - 5 - イル、1, 2, 3 - チアジアゾール - 4 - イル、1, 2, 3 - チアジアゾール - 5 - イル、1, 2, 5 - オキサジアゾール - 3 - イル、1, 2, 5 - チアジアゾール - 3 - イル、2 - ピリジニル、3 - ピリジニル、4 - ピリジニル、3 - ピリダジニル、4 - ピリダジニル、2 - ピリミジニル、4 - ピリミジニル、5 - ピリミジニル、2 - ピラジニル、1, 3, 5 - トリアジン - 2 - イル、1, 2, 4 - トリアジン - 3 - イル、1, 2, 4 - トリアジン - 5 - イル、1, 2, 4 - トリアジン - 6 - イルから選択されるモノ - またはポリ - Z² - 置換されていても良い5員もしくは6員ヘテロアリアルを表し、

Z²は、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₂ - アルキルチオ、C₁ - C₂ - アルコキシ、C₁ - C₂ - ハロアルキル、C₁ - C₂ - ハロチオアルキル、C₁ - C₂ - ハロアルコキシ、C₃ - C₆ - シクロアルキル、各場合でハロゲン - または C₁ - C₄ - アルキル - モノ置換されていても良いフェニルまたはフェノキシを表す。

【0052】

10

20

30

40

50

A は同様に非常に特に好ましくは、各場合で 2 - フリル、3 - フリル、2 - チエニル、3 - チエニル、2 - ピロリル、3 - ピロリル、1 - ピロリル、3 - ピラゾリル、4 - ピラゾリル、5 - ピラゾリル、2 - イミダゾリル、4 - イミダゾリル、5 - イミダゾリル、2 - オキサゾリル、4 - オキサゾリル、5 - オキサゾリル、2 - チアゾリル、4 - チアゾリル、5 - チアゾリル、3 - イソオキサゾリル、4 - イソオキサゾリル、5 - イソオキサゾリル、3 - イソチアゾリル、4 - イソチアゾリル、5 - イソチアゾリル、1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル、1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - イル、1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル、1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル、1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イル、1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル、1H - テトラゾール - 1 - イル、1H - テトラゾール - 5 - イル、1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル、1, 2, 4 - オキサジアゾール - 5 - イル、1, 2, 4 - チアジアゾール - 3 - イル、1, 2, 4 - チアジアゾール - 5 - イル、1, 3, 4 - オキサジアゾール - 2 - イル、1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル、2 - ピリジニル、3 - ピリジニル、4 - ピリジニル、3 - ピリダジニル、4 - ピリダジニル、2 - ピリミジニル、4 - ピリミジニル、5 - ピリミジニル、2 - ピラジニルから選択されるモノ - またはポリ - Z² - 置換されていても良い 5 員もしくは 6 員ヘテロアリアルを表し、

Z² は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - 、i - 、s - または t - ブチル、シクロプロピル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリクロロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジクロロメチル、ジフルオロクロロメチル、ジフル

Z² はさらには、フッ素、塩素またはメチルによって置換されたフェニルを表す。

【0053】

好ましいものとしてはさらには、R² および R³ が一体となって - (CH₂)₂ - を表す式 (I) の化合物がある。

【0054】

好ましいものとしてはさらには、R⁴ が水素を表す式 (I) の化合物がある。

【0055】

好ましいものとしてはさらには、Y が O を表す式 (I) の化合物がある。

【0056】

好ましいものとしてはさらには、Y が直接結合を表す式 (I) の化合物がある。

【0057】

好ましいものとしてはさらには、A がフッ素、塩素、臭素、ヨウ素、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシまたはトリフルオロメチルチオからなる群からの同一もしくは異なる置換基によってモノもしくはジ置換されていても良いフェニルを表す式 (I) の化合物がある。モノ置換の場合、その置換基は好ましくは、4 位にある。

【0058】

しかしながら、一般用語で上記で示され、好ましい範囲内で言及されている基の定義および説明を、所望に応じて互いに組み合わせることもでき、すなわち特定の範囲と好ましい範囲との間で組み合わせることができる。それらは最終生成物とそれに応じて前駆体および中間体の両方に適用される。さらに、個々の定義が適用されなくとも良い。

【0059】

好ましいものは、各場合で全ての基が上記の好ましい定義を有する式 (I) の化合物である。

【0060】

特に好ましいものは、各場合で全ての基が上記の特に好ましい定義を有する式 (I) の化合物である。

【0061】

非常に好ましいものは、各基が上記の最も好ましい定義を有する式 (I) の化合物である。

10

20

30

40

50

【発明を実施するための形態】

【0062】

上記の式にある記号の定義では、下記の置換基の代表的なものである総称を用いた。

【0063】

ハロゲン：（ハロアルキル、ハロアルコキシなどの組み合わせも含む）フッ素、塩素、臭素およびヨウ素；

アルキル：（アルキルチオ、アルコキシなどの組み合わせも含む）1から8個の炭素原子を有する飽和の直鎖もしくは分岐ヒドロカルビル基、例えばメチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル、1,1-ジメチルエチル、ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2,2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、ヘキシル、1,1-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピルおよび1-エチル-2-メチルプロピル；ヘプチル、オクチルなどのC₁-C₆-アルキル；

ハロアルキル：（ハロアルキルチオ、ハロアルコキシなどの組み合わせも含む）基における水素原子の一部または全てが上記で記載のようにハロゲン原子によって置き換わっていても良い1から8個の炭素原子を有する（上記で記載のように）直鎖もしくは分岐のアルキル基、例えばクロロメチル、プロモメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、1-クロロエチル、1-プロモエチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2-ジフルオロエチル、2,2-ジクロロ-2-フルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチルおよび1,1,1-トリフルオロプロパン-2-イルなどのC₁-C₃-ハロアルキル。

【0064】

アルケニル：2から8個の炭素原子およびいずれかの位置の1個の二重結合を有する不飽和の直鎖もしくは分岐ヒドロカルビル基、例えばエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチルエテニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-1-ブテニル、2-メチル-1-ブテニル、3-メチル-1-ブテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1,1-ジメチル-2-プロペニル、1,2-ジメチル-1-プロペニル、1,2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-1-ペンテニル、2-メチル-1-ペンテニル、3-メチル-1-ペンテニル、4-メチル-1-ペンテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1,1-ジメチル-2-ブテニル、1,1-ジメチル-3-ブテニル、1,2-ジメチル-1-ブテニル、1,2-ジメチル-2-ブテニル、1,2-ジメチル-3-ブテニル、1,3-ジメチル-1-ブテニル、1,3-ジメチル-2-ブテニル、1,3-ジメチル-3-ブテニル、2,2-ジメチル-3-ブテニル、2,3-ジメチル-1-ブテニル、2,3-ジメチル-2-ブテニル、2

、3 - ジメチル - 3 - ブテニル、3、3 - ジメチル - 1 - ブテニル、3、3 - ジメチル - 2 - ブテニル、1 - エチル - 1 - ブテニル、1 - エチル - 2 - ブテニル、1 - エチル - 3 - ブテニル、2 - エチル - 1 - ブテニル、2 - エチル - 2 - ブテニル、2 - エチル - 3 - ブテニル、1、1、2 - トリメチル - 2 - プロペニル、1 - エチル - 1 - メチル - 2 - プロペニル、1 - エチル - 2 - メチル - 1 - プロペニルおよび1 - エチル - 2 - メチル - 2 - プロペニルなどのC₂ - C₆ - アルケニル。

【0065】

シクロアルキル：シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチルおよびシクロオクチルなどの3から8個の炭素環員を有する単環式飽和ヒドロカルビル基。

10

【0066】

アリール：置換されていないか置換された芳香族の単環、二環または三環、例えばフェニル、ナフチル、アントラセニル（アントリル）、フェンアントラセニル（フェナントリル）。

【0067】

ヘタリール：4個以下の窒素原子あるいは1個の窒素原子と2個以下のN、OおよびSから選択される別のヘテロ原子を含む置換されていないか置換された不飽和の複素5から7員環：例えば2 - フリル、3 - フリル、2 - チエニル、3 - チエニル、2 - ピロリル、3 - ピロリル、1 - ピロリル、3 - ピラゾリル、4 - ピラゾリル、5 - ピラゾリル、1 - ピラゾリル、1H - イミダゾール - 2 - イル、1H - イミダゾール - 4 - イル、1H - イミダゾール - 5 - イル、1H - イミダゾール - 1 - イル、2 - オキサゾリル、4 - オキサゾリル、5 - オキサゾリル、2 - チアゾリル、4 - チアゾリル、5 - チアゾリル、3 - イソオキサゾリル、4 - イソオキサゾリル、5 - イソオキサゾリル、3 - イソチアゾリル、4 - イソチアゾリル、5 - イソチアゾリル、1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル、1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - イル、1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル、2H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 2 - イル、2H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - イル、1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル、1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イル、1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル、4H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル、4H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 4 - イル、1H - テトラゾール - 1 - イル、1H - テトラゾール - 5 - イル、2H - テトラゾール - 2 - イル、2H - テトラゾール - 5 - イル、1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル、1, 2, 4 - オキサジアゾール - 5 - イル、1, 2, 4 - チアジアゾール - 3 - イル、1, 2, 4 - チアジアゾール - 5 - イル、1, 3, 4 - オキサジアゾール - 2 - イル、1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル、1, 2, 3 - オキサジアゾール - 4 - イル、1, 2, 3 - オキサジアゾール - 5 - イル、1, 2, 3 - チアジアゾール - 4 - イル、1, 2, 3 - チアジアゾール - 5 - イル、1, 2, 5 - オキサジアゾール - 3 - イル、1, 2, 5 - チアジアゾール - 3 - イル、2 - ピリジニル、3 - ピリジニル、4 - ピリジニル、3 - ピリダジニル、4 - ピリダジニル、2 - ピリミジニル、4 - ピリミジニル、5 - ピリミジニル、2 - ピラジニル、1, 3, 5 - トリアジン - 2 - イル、1, 2, 4 - トリアジン - 3 - イル、1, 2, 4 - トリアジン - 5 - イル、1, 2, 4 - トリアジン - 6 - イル。

20

30

40

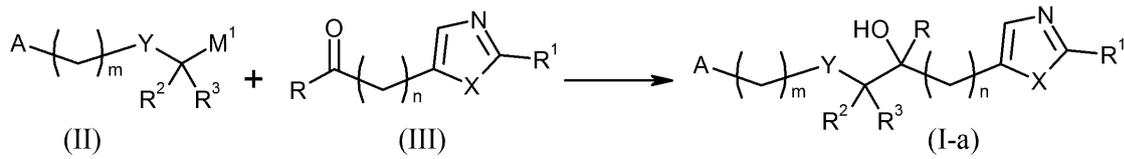
【0068】

方法および中間体の説明

式(I)の複素環アルカノール誘導体は、各種方法で製造することができる(EP - A 0 4 0 9 4 1 8およびEP - A 0 3 9 5 1 7 5参照)。最初に、可能な方法を下記に模式的に示してある。別段の断りがない限り、記載の基は上記で示した意味を有する。別段の断りがない限り、基はそれぞれ上記で定義された通りである。

【化 2】

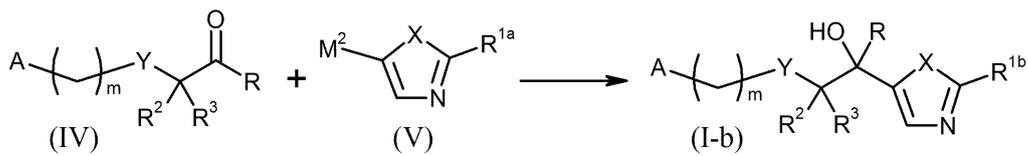
図式 1 : 方法 A



M¹は金属または金属ハライド、例えばリチウム、マグネシウム (Mg-Hal、Hal=ハロゲン)、チタン [Ti(OAlk)₃、Alk=C₁-C₄-アルキル] である。

10

図式 2 : 方法 B (n=0)

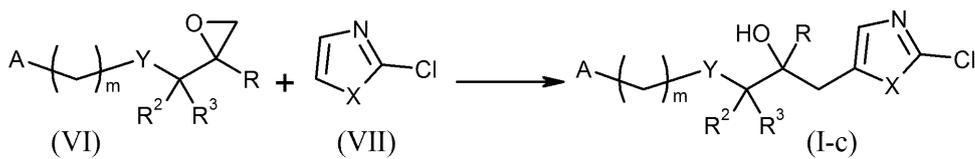


M²は金属、例えばリチウムを表す。

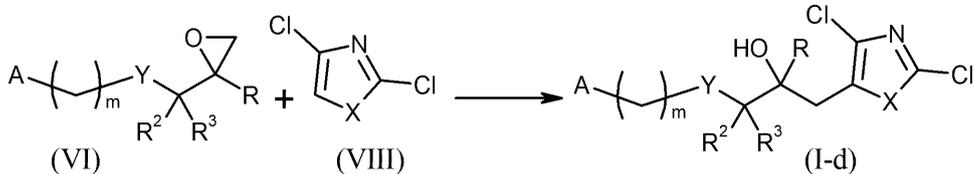
R^{1a}は塩素およびSi(アルキル)₃を表す。

R^{1b}は水素、塩素およびSi(アルキル)₃を表す。

20

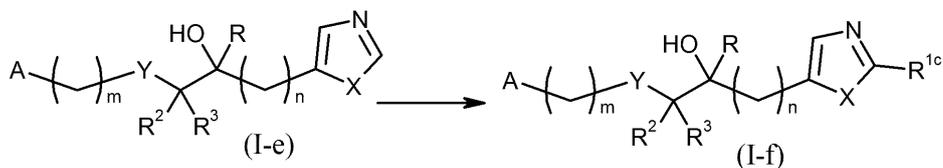
図式 3 : 方法 C (n=1、R¹=塩素)

30

図式 4 : 方法 D (n=1、R¹=塩素)

40

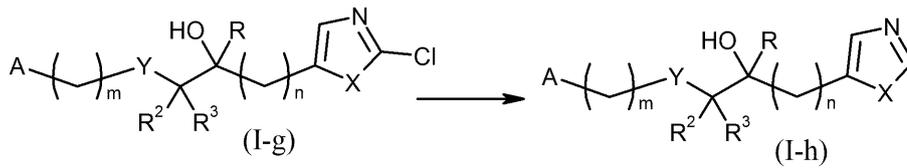
図式 5 : 方法 E



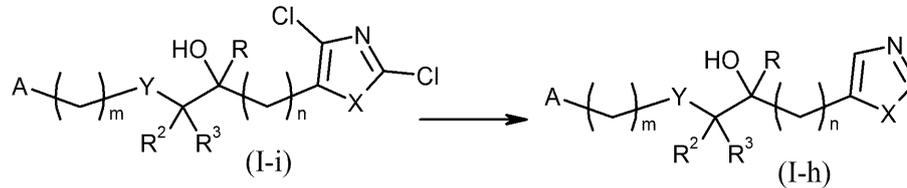
R^{1c}は、SH、アルキルチオ、アルコキシ、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルキルチオ、ハロアルコキシ、シアノ、ニトロを表す。

50

図式6：方法F

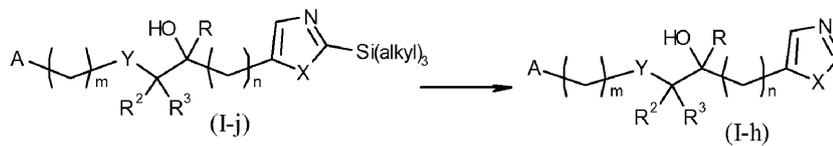


図式7：方法G



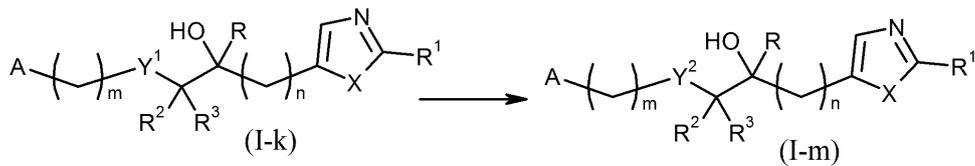
10

図式8：方法H



20

図式9：方法I

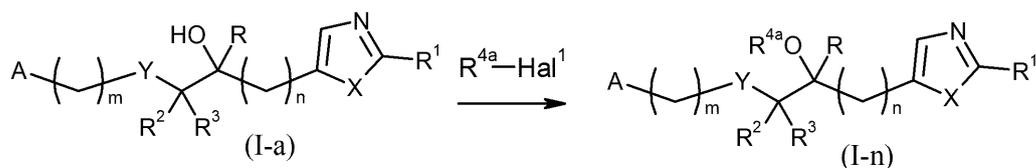


30

Y^1 は、Sを表す。

Y^2 は、SOまたは SO_2 を表す。

図式10：方法J



40

R^{4a} は、置換されていても良いアルキルカルボニル、アルキル、ホルミルまたはトリアルキルシリルを表す、

Hal^1 は、塩素または臭素を表す。

【0069】

上記および下記の式および図式における好ましい基の定義は、上記ですでに示してある

50

。これらの定義は、式 (I) の最終生成物だけではなく、同様に全ての中間体にも適用される。

【 0 0 7 0 】

方法 A

本発明による方法 A の実施における原料として必要な式 (I I) の化合物の一部は公知である。それらは、公知の方法で製造することもできる (Z . A n o r g . A l l g . C h e m . 2 0 0 1 , 6 2 7 , 2 4 0 8 - 2 4 1 2 参照) 。

【 0 0 7 1 】

本発明による方法 A の原料としてさらに必要な式 (I I I) のケトンも公知の方法によって製造することができる (E P - A 0 4 0 9 4 1 8 、 E P - A 0 3 9 5 1 7 5 参照) 。

10

【 0 0 7 2 】

本発明による方法 A は代表的には、 - 8 0 から + 8 0 の温度で、希釈剤、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフランまたはジクロロメタンの存在下に行う。得られた生成物を、プロトン供与体によって捕捉する。

【 0 0 7 3 】

本発明による反応は好ましくは、特に窒素またはアルゴンなどの不活性ガス下に行う。

【 0 0 7 4 】

方法 B

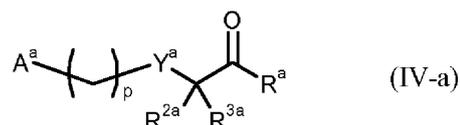
本発明による方法 B の実施で原料として要求される式 (I V) のケトンの一部は公知である。それらは公知の方法で製造することができる (E P - A 0 4 0 9 4 1 8 、 D E - A 3 4 4 0 1 1 6 、 E P - A 0 1 8 0 1 3 6 、 J P - A 0 6 - 2 7 9 4 1 9 、 D E - A 3 2 2 0 7 3 0 、 J P - A 0 4 - 1 1 2 8 7 4 参照) 。

20

【 0 0 7 5 】

例えば、下記式 (I V - a) のケトンは新規である。

【 化 3 】



【 0 0 7 6 】

30

式中、

Y^a は、O、S、SO または SO_2 を表し

p は、0 または 1 を表し、

R^a は、各場合で置換されていても良いアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルまたはアリールを表し、

R^{2a} は、ハロゲンまたは置換されていても良いアルキルを表し、

R^{3a} は、水素、ハロゲンまたは置換されていても良いアルキルを表し、

R^{2a} および R^{3a} が一緒に、置換されていても良い $C_2 - C_5$ - アルキレンをさらに表すことができ、

A^a は、置換されていても良いアリールまたは置換されていても良いヘテロアリールを表し、

40

ここで、 Y^a 、 p 、 R^a 、 R^{2a} 、 R^{3a} および A^a はそれぞれ、適用される場合、 Y 、 m 、 R 、 R^2 、 R^3 および A の好ましい、特に好ましい、非常に特に好ましい、特別に好ましい意味を有する。

【 0 0 7 7 】

好ましいものは、 R^{2a} および R^{3a} がそれぞれメチルを表す式 (I V - a) のケトンである。

【 0 0 7 8 】

好ましいものは、 R^{2a} および R^{3a} が一体となって $-(CH_2)_2-$ を表す式 (I V - a) のケトンである。

50

【0079】

好ましいものは、 R^a がtert-ブチルを表す式(IV-a)のケトンである。

【0080】

好ましいものは、 R^a がフッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシまたはトリフルオロメチルチオからなる群からの同一もしくは異なる置換基によってモノ置換もしくはジ置換されているフェニルを表す式(IV-a)のケトンである。

【0081】

本発明による方法Bの原料としてやはり必要な式(V)の有機金属複素環は公知である(EP-A0409418およびEP-A0395175参照)。

10

【0082】

式(V)の有機金属複素環の製造の場合、2位に好適な保護基、例えばトリメチルシリルを設けて、 M^2 を5位に指向させることが有利な場合がある。必要というわけではないが、式(IV)のケトンとの反応の前に、この保護基を脱離させることができる。

【0083】

本発明による方法Bは代表的には、-120 から+80 の温度で希釈剤、例えばテトラヒドロフランまたはジエチルエーテルの存在下に行う。得られた生成物を、プロトン供与体で捕捉する。

【0084】

本発明による反応は好ましくは、特に窒素もしくはアルゴンなどの不活性ガス下で行う。

20

【0085】

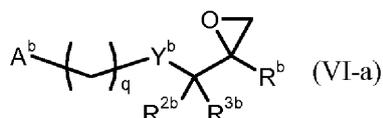
方法C

本発明による方法Cを行う上で原料として必要な式(VI)のオキシラン誘導体の一部は公知であるか(例えば、DE-A3608792、DE-A3535456)、公知の方法によって製造することができる(EP-A0121171、DE-A3608792、DE-A3535456、DE-A3627071参照)。

【0086】

例えば、下記式(VI-a)のオキシラン誘導体は新規である。

【化4】



30

【0087】

式中、

Y^b は、O、S、SOまたは SO_2 を表し、

q は、0または1を表し、

R^b は、各場合で置換されていても良いアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルまたはアリールを表し、

40

R^{2b} は、ハロゲンまたは置換されていても良いアルキルを表し、

R^{3b} は、水素、ハロゲンまたは置換されていても良いアルキルを表し、

R^{2b} および R^{3b} が一緒に、置換されていても良い C_2-C_5 -アルキレンをさらに表すことができ、

A^b は、置換されていても良いアリールまたは置換されていても良いヘテロアリールを表し、

ここで、 Y^b 、 q 、 R^b 、 R^{2b} 、 R^{3b} および A^b はそれぞれ、適用される場合、 Y 、 m 、 R 、 R^2 、 R^3 およびAの好ましい、特に好ましい、非常に特に好ましい、特別に好ましい意味を有する。

【0088】

50

好ましいものは、 R^{2b} および R^{3b} がそれぞれメチルを表す式 (VI - a) のケトンである。

【0089】

好ましいものは、 R^{2b} および R^{3b} が一体となって $-(CH_2)_2-$ を表す式 (VI - a) のケトンである。

【0090】

好ましいものは、 R^b が tert - ブチルを表す式 (VI - a) のケトンである。

【0091】

好ましいものは、 R^b がフッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシまたはトリフルオロメチルチオからなる群からの同一もしくは異なる置換基によってモノ置換もしくはジ置換されているフェニルを表す式 (VI - a) のケトンである。

10

【0092】

式 (VII) の 2 - クロロ - 1 , 3 - チアゾールは公知である。

【0093】

オキシラン式 (VI) のオキシラン誘導体の変換において、有機金属化合物、特にアルキルリチウム化合物 (例えば n - ブチルリチウム) を用いることが可能である (EP - A 0 3 9 5 1 7 5 参照)。

【0094】

本発明による方法 C は代表的には、希釈剤、例えばテトラヒドロフランまたはジエチルエーテルの存在下に、 -120 から $+80$ の温度で行う。得られた生成物をプロトンドナーによって捕捉する。

20

【0095】

本発明による反応は好ましくは、特に窒素またはアルゴンなどの不活性ガス中で行う。

【0096】

方法 D

本発明による方法 D を行う上での原料として必要な式 (VI) のオキシラン誘導体は、方法 C 下で既に説明している。

【0097】

式 (VII I) の 2 , 4 - ジクロロ - 1 , 3 - チアゾールは公知である。

30

【0098】

式 (VII I) のオキシラン誘導体の変換において、有機金属化合物、特にアルキルリチウム化合物 (例えば n - ブチルリチウム) を用いることが可能である (参照 EP - A 0 3 9 5 1 7 5)。

【0099】

本発明による方法 D は代表的には、希釈剤、例えばテトラヒドロフランまたはジエチルエーテルの存在下に、 -120 から $+80$ の温度で行う。得られた生成物はプロトン供与体で捕捉される。

【0100】

本発明による反応は好ましくは、特に窒素もしくはアルゴンなどの不活性ガス下で行う。

40

【0101】

方法 E

上記の方法で製造可能な式 (I - e) の化合物はさらに、一般構造 (I - f) の標的化合物に変換することができる。

【0102】

式 (I - e) の化合物の変換においては、有機金属化合物、特にアルキルリチウム化合物 (例えば n - ブチルリチウム) を用いることが可能である (EP - A 0 9 0 6 2 9 2 参照)。

【0103】

50

中間体として生成する有機金属化合物は代表的には、求電子体（例えば硫黄、アルキルハライド、ハロゲン間化合物）と反応させて、標的化合物（I - f）を得る。

【0104】

本発明による方法Eは代表的には、希釈剤、例えばテトラヒドロフランまたはジエチルエーテルの存在下に、-120 から+80 の温度で行う。得られた生成物はプロトン供与体で捕捉される。

【0105】

本発明による反応は好ましくは、特に窒素もしくはアルゴンなどの不活性ガス下で行う。

【0106】

10

方法F

上記の方法で製造可能な式（I - g）の化合物はさらに、一般構造（I - h）の標的化合物に変換することができる。

【0107】

式（I - g）の化合物の変換においては、金属、好ましくは亜鉛を用いることが可能である（EP - A 0 3 9 5 1 7 5 参照）。

【0108】

本発明による方法Fは代表的には、希釈剤、例えばテトラヒドロフランまたは有機酸、例えば酢酸の存在下に、-120 から+150 の温度で行う。

【0109】

20

方法G

上記方法で製造可能な式（I - i）の化合物はさらに、一般構造（I - h）の標的化合物に変換することができる。

【0110】

式（I - i）の化合物の変換においては、金属、好ましくはラネーニッケルまたはパラジウム、および水素、通常は0.1から5MPa（1から50バール）の水素を用いることができる（Synthetic Communications, 1995, 4081 - 4086 参照）。

【0111】

本発明による方法Gは代表的には、希釈剤、例えばメタノールまたはエタノールの存在下に、0 から+150 の温度で行う。

30

【0112】

方法H

上記の方法で製造可能な式（I - j）の化合物はさらに、一般構造（I - h）の標的化合物に変換することができる。

【0113】

式（I - j）の化合物の変換においては、無機または有機酸、好ましくは塩酸およびp-トルエンスルホン酸（US 2 0 0 9 / 0 3 1 8 4 3 6 A、US 2 0 0 8 / 0 2 6 7 9 4 2 A、Organic Letters, 2010, 236 - 238 参照）、またはフルオリド、好ましくはテトラブチルアンモニウムフルオリド（Organic Letters, 2010, 5470 - 5473 参照）を用いることが可能である。

40

【0114】

本発明による方法Hは代表的には、希釈剤、例えばテトラヒドロフランの存在下に、-40 から+150 の温度で行う。

【0115】

方法I

上記の方法で製造可能な式（I - k）の化合物はさらに、一般構造（I - m）の標的化合物に変換することができる。

【0116】

Iの変換においては、酸化剤、特に過酸化水素または過酸（例えば過酸化水素またはメ

50

タ - クロロ過安息香酸) を用いることが可能である。

【0117】

本発明による方法 I は代表的には、希釈剤、例えばジクロロメタンの存在下に、 -20 から $+100$ の温度で行う。

【0118】

方法 J

本発明による方法 J を行う上で原料として必要な式 (I - a) のアルコール誘導体は、本発明の主題の一部を形成するものであり、方法 A、B、F、G、H および I に従って製造することができる。

【0119】

使用されるハライド $R^{4a} - Hal^1$ は公知である。

【0120】

本発明による方法 J は、希釈剤の存在下に、そして適切であれば、塩基の存在下に行う。適切であれば、次に、得られた式 (I - n) の化合物に酸または金属塩を加える (下記参照) 。

【0121】

本発明による反応に好適な希釈剤は、不活性である全ての有機溶媒である。これらには好ましくは、例えばアセトンおよび 2 - ブタノンなどのケトン類；例えばアセトニトリルなどのニトリル類；例えば酢酸エチルなどのエステル類；例えばジオキサンなどのエーテル類；例えばベンゼンおよびトルエンなどの芳香族炭化水素類；または例えばジクロロメタンなどの塩素化炭化水素類などがある。

【0122】

本発明による反応に好適な塩基は、一般に使用される全ての有機および無機塩基である。これらには好ましくは、例えば炭酸ナトリウムまたは炭酸カリウムなどのアルカリ金属炭酸塩；例えば水酸化ナトリウムなどのアルカリ金属水酸化物；例えばナトリウムメトキシドおよびカリウムメトキシドおよびナトリウムエトキシドおよびカリウムエトキシドなどのアルカリ金属アルコキシド類；例えば水素化ナトリウムなどのアルカリ金属水素化物；さらには特にはトリエチルアミンなどの低級三級アルキルアミン、シクロアルキルアミン類およびアラキルアミン類などがある。特に好ましくは、水素化ナトリウムを用いる。

【0123】

本発明による方法 D を行う場合、反応温度は比較的広い範囲内で変動させることができる。概して当該方法は、 -20 から 100 、好ましくは 0 から 60 の温度で行う。

【0124】

適切であれば、本発明による反応は、加圧下で行うことができる。概して、当該反応は、 0.1 から $5 MPa$ (1 から 50 パール)、好ましくは 0.1 から $2.5 MPa$ (1 から 25 パール) で行う。

【0125】

本発明による方法 D を行う場合、好ましくは、一般式 (I - a) のアルコール 1 モル当たり、式 $R^{4a} - Hal^1$ のハライド 1 から 2 モルおよび適切であれば塩基 1 から 2 モルを用いる。最終生成物の単離は一般的な方法で行う。

【0126】

本発明による一般式 (I) の本発明の複素環アルカノール誘導体は、酸付加塩または金属塩錯体に変換することができる。

【0127】

一般式 (I) の化合物の生理的に許容される酸付加塩を製造する上で好適なものは好ましくは、ハロゲン化水素酸、例えば塩酸および臭化水素酸、特には塩酸、さらにはリン酸、硝酸、硫酸、1 官能性および 2 官能性カルボン酸およびヒドロキシカルボン酸類、例えば酢酸、マレイン酸、コハク酸、フマル酸、酒石酸、クエン酸、サリチル酸、ソルビン酸

10

20

30

40

50

、乳酸、およびスルホン酸類、例えば p - トルエンスルホン酸および 1 , 5 - ナフタレンジスルホン酸という酸である。

【 0 1 2 8 】

一般式 (I) の化合物の酸付加塩は、塩を形成するための一般的な方法によって、例えば好適な不活性溶媒に一般式 (I) の化合物を溶かし、酸、例えば塩酸を加えることで簡単に得ることができ、公知の方法で、例えばそれを濾過することで単離することができ、必要であれば、不活性有機溶媒で洗浄することで精製することができる。

【 0 1 2 9 】

一般式 (I) の化合物の金属塩錯体の製造において、好ましい選択肢は、周期律表の主族 I I から I V ならびに遷移族 I および I I および I V から V I I I の金属の塩であり、例としては銅、亜鉛、マンガン、マグネシウム、スズ、鉄およびニッケルである。

10

【 0 1 3 0 】

塩の好適なアニオンには、好ましくは、ハロゲン化水素酸、例えば塩酸および臭化水素酸、さらにはリン酸、硝酸および硫酸という酸から誘導されるものなどがある。

【 0 1 3 1 】

一般式 (I) の化合物の金属塩錯体は、一般的な方法によって、例えばアルコール、例えばエタノールに金属塩を溶かし、その溶液を一般式 I の化合物に加えることによって簡単に得ることができる。金属塩錯体は、公知の方法で、例えば濾過することで単離することができ、必要であれば、再結晶によって精製することができる。

【 0 1 3 2 】

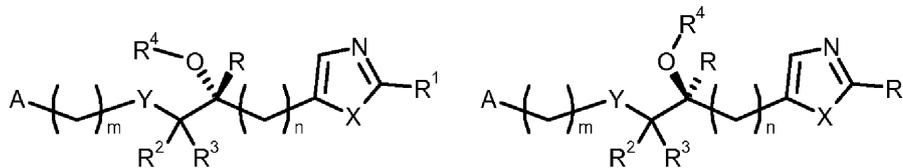
本発明に従って用いることができる複素環アルコール誘導体は、異なる可能な異性体、特に立体異性体、例えば E および Z 異性体、トレオおよびエリトロ異性体、および光学異性体の混合物として存在しても良いが、適切な場合には互変異体の混合物として存在しても良い。特許請求されるものは、E および Z 異性体、さらにはトレオおよびエリトロ、さらには光学異性体の両方、これら異性体のいずれかの混合物、さらには可能な互変異型である。

20

【 0 1 3 3 】

適切な場合、式 (I) の化合物は特に、エナンチオマーの形態で存在する。

【 化 5 】

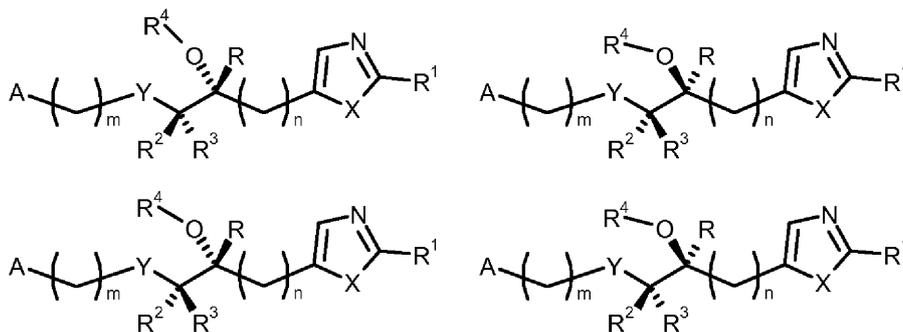


30

【 0 1 3 4 】

置換基 R² および R³ が異なる場合、下記のジアステレオマーが各種混合物で存在しても良い。

【 化 6 】



40

【 0 1 3 5 】

本発明はさらに、本発明による化合物を含む、望ましくない微生物、特に望ましくな

50

い真菌を防除するための作物保護組成物に関するものである。その組成物は好ましくは農業的に好適な補助剤、溶媒、担体、界面活性剤または増量剤を含む殺菌剤組成物である。

【0136】

さらに、本発明は、望ましくない微生物を防除する方法において、本発明による活性化化合物を植物病原性真菌および/またはその生息場所に施用することを特徴とする方法に関するものである。

【0137】

本発明によれば、担体は、特に植物または植物部分または種子への施用において、より良好な施用を行うために活性化化合物と混合または組み合わせられる天然もしくは合成の有機もしくは無機物質である。担体は固体または液体であることができ、通常は不活性であり、農業での使用に好適なものでなければならない。

10

【0138】

有用な固体または液体担体には、例えば、アンモニウム塩およびカオリン類、粘土類、タルク、チョーク、石英、アタパルガイト、モンモリロナイトまたは珪藻土などの天然岩粉および微粉碎シリカ、アルミナおよび天然もしくは合成シリケート類などの合成岩粉、樹脂類、ロウ類、固体肥料、水、アルコール類、特にブタノール、有機溶媒、鉱油および植物油およびこれらの誘導体などがある。そのような担体の混合物も使用可能である。粒剤用の有用な固体担体には、例えば方解石、大理石、軽石、海泡石、ドロマイトなどの破碎および分別された天然岩石ならびに無機および有機ミールの合成顆粒およびおがくず、ヤシ殻、トウモロコシ穂軸およびタバコ茎などの有機材料の顆粒などがある。

20

【0139】

好適な液化ガス増量剤または担体は、環境温度および大気圧では気体である液体であり、例えば、エアロゾル噴射剤、例えばハロゲン化炭化水素、さらにはブタン、プロパン、窒素および二酸化炭素が挙げられる。

【0140】

カルボキシメチルセルロース、粉末、顆粒またはアラビアガム、ポリビニルアルコールおよびポリ酢酸ビニルなどのラテックスの形態での天然および合成ポリマー類、またはセファリン類およびレシチン類などの天然リン脂質および合成リン脂質などの粘着付与剤を製剤で用いることができる。別の添加剤には鉱油および植物油があり得る。

【0141】

使用される増量剤が水である場合、例えば、補助溶媒として有機溶媒を用いることも可能である。実質的に、好適な液体溶媒は、キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレン類などの芳香族化合物、そしてクロロベンゼン類、クロロエチレン類またはジクロロメタンなどの塩素化芳香族化合物または塩素化脂肪族炭化水素基、シクロヘキサンまたはパラフィン類などの脂肪族炭化水素基、例えば鉱油留分、鉱油および植物油、ブタノールもしくはグリコールなどのアルコール類およびそれらのエーテル類およびエステル類、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンもしくはシクロヘキサノンなどのケトン類、ジメチルホルムアミドおよびジメチルスルホキシドなどの強極性溶媒および水である。

30

【0142】

本発明による組成物は、例えば界面活性剤などの別のさらなる成分を含むことができる。好適な活性剤は、乳化剤および/または発泡剤、分散剤またはイオン性もしくはノニオン性を有する湿展剤、またはこれら界面活性剤の混合物である。これらの例は、ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸またはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキサイドと脂肪族アルコール類もしくは脂肪酸もしくは脂肪族アミン類との重縮合物、置換フェノール類（好ましくはアルキルフェノール類またはアリールフェノール類）、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導体（好ましくはタウリン酸アルキル）、ポリエトキシ化アルコール類またはフェノールのリン酸エステル、多価アルコールの脂肪族エステル、および硫酸エステル、スルホン酸エステルおよびリン酸エステルを含む化合物の誘導体、例えばアルキルアリールポリグリコールエーテル類、スルホン酸

40

50

アルキル類、硫酸アルキル類、スルホン酸アリール類、タンパク質加水分解物、リグノ亜硫酸廃液およびメチルセルロースである。活性化合物のうちの一つおよび/または不活性担体のうちの一つが水に不溶であり、施用を水系で行う場合には、界面活性剤が存在する必要がある。界面活性剤の割合は、本発明による組成物の5から40重量%である。

【0143】

無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタンおよびプルシアンブルーなどの着色剤およびアリザリン色素、アゾ色素および金属フタロシアニン色素などの有機着色剤および鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩などの微量栄養素を用いることが可能である。

【0144】

適切であれば、他の別の成分が存在していても良く、例えば保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、チキソトロピー物質、浸透剤、安定剤、金属イオン封鎖剤、錯体形成剤である。概して、活性化合物は、製剤用に一般に使用される固体もしくは液体添加剤と組み合わせることができる。

【0145】

本発明による組成物および製剤は、0.05から99重量%、0.01から98重量%、好ましくは0.1から95重量%、特に好ましくは0.5から90%の活性化合物、非常に特に好ましくは10から70重量%を含む。

【0146】

本発明による活性化合物または組成物は、そのまま用いることができるか、それらの個々の物理的および/または化学的特性に応じて、それらの製剤またはそれから製造される使用形態で用いることができ、例えばエアロゾル、カプセル懸濁液、低温フォギング(cold-fogging)濃縮物、温フォギング(warm-fogging)濃縮物、カプセル化粒剤、微細粒剤、種子処理用のフロアブル製剤、即時使用液剤、粉剤、乳剤、水中油型乳濁液、油中水型乳濁液、巨大顆粒、微細顆粒、油分散性粉剤、油混和性フロアブル製剤、油混和性液体、発泡剤、ペースト、農薬コートした種子、懸濁濃縮液、サスポエマルジョン濃縮液、可溶性濃縮液、懸濁液、水和剤、可溶性粉末、ダスト剤および粒剤、水溶性の粒剤もしくは錠剤、種子処理用の水溶性粉剤、水和剤、天然物および活性化合物で含浸させた合成物質、ならびに種子用のポリマー物質およびコーティング材料中のマイクロカプセル、ならびにULV低温フォギングおよび温フォギング製剤がある。

【0147】

上記の製剤は、それ自体公知の方法で、例えば活性化合物を少なくとも1種類の一般的な増量剤、溶媒もしくは希釈剤、乳化剤、分散剤および/または結合剤または固定剤、湿展剤、撥水剤、適切な場合には乾燥剤およびUV安定剤ならびに適切な場合は色素および顔料、消泡剤、保存剤、二次増粘剤、接着剤、ジベレリン類、さらに別の加工補助剤とを混合することで製造することができる。

【0148】

本発明による組成物には、即時使用され、好適な装置を用いて植物もしくは種子に施用することができる製剤だけでなく、使用前に水で希釈しなければならない商業的濃縮物も含まれる。

【0149】

本発明による活性化合物はそれ自体で存在することができるか、その(商業的)製剤および殺虫剤、誘引剤、滅菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、成長調節剤、除草剤、肥料、薬害軽減剤および/または情報物質などの他の(公知の)活性化合物との混合物としてこれらの製剤から調製される使用形態で存在することができる。

【0150】

活性化合物または組成物による植物および植物部分の本発明による処理は、一般的な処理方法を用いて、例えば浸漬、噴霧、霧化、灌水、蒸発、散粉、雲霧、散布、発泡、塗布、展着、散水(灌注)、細流灌漑によって、そして繁殖物の場合、特に種子の場合はさらに、乾式種子処理用粉剤、種子処理用液剤、スラリー処理用水溶性粉末として、蓄積に

10

20

30

40

50

より、1以上の層によるコーティングなどによって、直接行うか、その環境、生育場所または保管場所への作用によって行う。さらに、超微量法によって活性化化合物を施用するか、活性化化合物の製剤もしくは活性化化合物自体を土壌に注入することも可能である。

【0151】

本発明はさらに、種子の処理方法を含む。

【0152】

本発明はさらに、前段落に記載の方法の一つに従って処理された種子に関するものである。本発明による種子は、望ましくない真菌からの種子を保護する方法で用いられる。これらの方法では、少なくとも一つの本発明による活性化化合物で処理された種子を用いる。

10

【0153】

本発明による活性化化合物または組成物は、種子の処理にも適している。有害生物によって引き起こされる作物に対する損傷の大部分が、貯蔵時もしくは播種後、ならびに植物の発芽時および発芽後の両方の種子の感染によって引き起こされる。成長する植物の根および新芽が特に感受性が高く、ごく小さな損傷であっても植物の枯死に至る可能性があることから、この時期は特に重要である。従って、適切な組成物を用いることで、種子および発芽植物を保護することに対する関心が非常に高い。

【0154】

植物の種子を処理することによる植物病原菌の防除についてはかなり以前から知られており、現在もなお改善が続いているテーマである。しかしながら、種子の処理には、常に満足な形で解決できるとは限らない一連の問題が伴う。従って、植物の播種後もしくは発芽後の作物保護組成物の追加施用を行わずに済みますか、少なくとも大幅に減らす、種子および発芽植物の保護方法を開発することが望ましい。そのようにして用いられる活性化化合物の量を至適化することで、使用される活性化化合物による植物自体に対する損傷を生じることなく、植物病原菌による攻撃から種子および発芽植物を至適に保護することがさらに望ましい。特に、種子の処理方法では、遺伝子組み換え植物の固有の殺菌特性も考慮して、作物保護組成物の使用を最小限としながら、種子および発芽植物の保護を最大とすることを考慮すべきである。

20

【0155】

従って本発明は、本発明による組成物で種子を処理することで、種子および発芽植物を植物病原菌による攻撃から保護する方法に関するものでもある。本発明はさらに、植物病原性真菌に対して種子および発芽植物を保護するために種子を処理する上での本発明による組成物の使用に関するものでもある。さらに本発明は、植物病原性真菌に対する保護のために本発明による組成物で処理した種子に関するものでもある。

30

【0156】

発芽後に植物に損傷を与える植物病原菌の防除は、主として土壌および植物の地上部を作物保護剤で処理することで行う。作物保護剤が環境ならびにヒトおよび動物の健康に与える可能性がある影響に関して懸念があるために、施用される活性化化合物の量を減らすための努力がなされている。

【0157】

本発明の利点の一つは、本発明による活性化化合物および組成物の特定の全身的性質が、これら活性化化合物および組成物による種子の処理が、植物病原菌から、種子自体を保護するだけでなく、発芽後の得られた植物も保護することを意味する。このようにして、播種時またはその直後の時点での作物の直接処理を行わずに済ませることができる。

40

【0158】

本発明による活性化化合物または組成物を特に、種子から成長する植物が病害生物に対して作用するタンパク質を発現する能力を有する遺伝子組み換え種子にも用いることが可能であることも有利であると考えられる。そのような種子を本発明による活性化化合物もしくは組成物で処理することで、例えば殺虫性タンパク質の発現によって、ある種の病害生物を防除することができる。驚くべきことに、この場合にはさらなる相乗効果が認められる

50

可能性があり、その場合には病害生物による攻撃に対する保護の有効性が相加的に高くなる。

【0159】

本発明による組成物は、農業、温室、森林、造園およびぶどう園において使用されるあらゆる種類の植物品種の種子を保護するのに適している。特に、これは、穀類（小麦、大麦、ライ小麦、モロコシ/キビおよびカラス麦など）、トウモロコシ、棉、大豆、米、ジャガイモ、ヒマワリ、豆類、コーヒー、ビート（例えば、テンサイおよび飼料用ビート）、ピーナッツ、アブラナ、ケシ、オリーブ、ココナッツ、カカオ、サトウキビ、タバコ、野菜（例えば、トマト、キュウリ、タマネギおよびレタスなど）、芝生および観賞植物（下記も参照）の種子の形態を取る。穀類（小麦、大麦、ライ小麦、カラス麦など）、トウモロコシおよび米の処理が特に重要である。

10

【0160】

下記でもさらに述べるように、本発明による活性化合物または組成物を用いて遺伝子組み換え種子を処理することは、特に重要である。これは、殺虫特性を有するポリペプチドまたはタンパク質の発現を可能とする少なくとも1種の異種遺伝子を含む植物種子を指す。遺伝子組み換え種子中の異種遺伝子は、例えばバチルス種（*Bacillus*）、リゾビウム種（*Rhizobium*）、シュードモナス種（*Pseudomonas*）、セツラティア種（*Serratia*）、トリコデルマ種（*Trichoderma*）、クラウイバクテル種（*Clavibacter*）、グロムス種（*Glomus*）またはグリオクラディウム種（*Gliocladium*）などの微生物由来であることができる。好ましくは、この異種遺伝子はバチルス種由来であり、その場合に、遺伝子産物はヨーロッパコーンボラー（*European corn borer*）および/またはウエスタンコーンルートワーム（*Western corn rootworm*）に対して有効である。特に好ましくは、異種遺伝子はバチルス・トゥリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）由来である。

20

【0161】

本発明の文脈の範囲内で、本発明による組成物は、単独でまたは好適な製剤で種子に施用される。好ましくは、種子は、処理中に損傷が起こらないようにする上で十分安定である状態で処理される。概して、種子の処理は、収穫と播種の間いずれかの時点で行うことができる。植物から分離され、穂軸、殻、茎、外被、毛または果実の実を含まない種子を用いるのが一般的である。従って、例えば収穫、浄化および乾燥させて含水率15重量%未満とした種子を用いることが可能である。あるいは、乾燥後に、例えば水で処理し、次に再乾燥した種子を用いることも可能である。

30

【0162】

種子を処理する場合、種子に施用される本発明による組成物の量および/または別の添加剤の量を、種子の発芽に悪影響がないか、得られる植物に損傷がないように選択するよう注意を払う必要がある。これについては特に、ある一定の施用量で植物毒性効果を有し得る活性化合物の場合には特に留意すべきである。

【0163】

本発明による組成物は直接施用することができる、すなわち他の成分を含んだり、希釈せずに施用することができる。通常、好適な製剤の形で種子に組成物を施用することが好ましい。好適な製剤および種子処理方法は当業者には公知であり、例えば次の文書US 4, 272, 417、US 4, 245, 432、US 4, 808, 430、US 5, 876, 739、US 2003/0176428A1、WO 2002/080675、WO 2002/028186に記載されている。

40

【0164】

本発明に従って使用することができる活性化合物は、液剤、乳濁液、懸濁液、粉剤、泡剤、スラリーまたは種子用の他のコーティング組成物などの一般的な種子被覆製剤およびULV製剤に変換することができる。

【0165】

50

これらの製剤は、公知の方法で、活性化化合物を例えば、一般的な増量剤などの一般的な添加剤、さらには溶媒もしくは希釈剤、色素、湿展剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、保存剤、二次増粘剤、接着剤、ジベレリン類および水と混合することで製造される。

【0166】

本発明に従って用いることができる種子被覆製剤中に存在させることができる色素には、そのような目的に一般的な全ての色素がある。それに関しては、水溶解度が非常に低い顔料だけでなく、水に可溶性色素も用いることができる。例としては、ローダミンB、C、I、ピグメントレッド112およびC、I、ソルベントレッド1の名称で知られる色素などがある。

【0167】

本発明に従って用いることができる種子被覆製剤中に存在させることができる好適な湿展剤には、濡れを促進し、農薬活性化化合物の製剤に従来使用される物質がある。好ましいものは、アルキルナフタレン-スルホネート類、例えばスルホン酸ジイソプロピルもしくはジイソブチルナフタレンである。

【0168】

本発明に従って用いることができる種子被覆製剤中に存在させることができる好適な分散剤および/または乳化剤には、農薬活性化化合物の製剤で従来使用される全てのノニオン系、アニオン系およびカチオン系の分散剤である。好ましく使用できるものは、ノニオン系もしくはアニオン系分散剤またはノニオン系もしくはアニオン系分散剤の混合物である。挙げることができる好適なノニオン系分散剤には特には、エチレンオキサイド/プロピレンオキサイドブロックポリマー類、アルキルフェノールポリグリコールエーテル類およびトリスチリルフェノールポリグリコールエーテル類およびそれらのリン酸化もしくは硫酸化誘導体などがある。好適なアニオン系分散剤は特には、リグノスルホネート類、ポリアクリル酸塩およびアリアルスルホネート/ホルムアルデヒド縮合物である。

【0169】

本発明に従って用いることができる種子被覆製剤中に存在させることができる消泡剤には、農薬活性化化合物の製剤に従来使用される全ての発泡禁止化合物がある。好ましくはシリコーン系消泡剤およびステアリン酸マグネシウムを用いることができる。

【0170】

本発明に従って使用することができる種子被覆製剤中に存在させることができる保存剤には、農薬組成物中でそのような目的で使用可能な全ての物質がある。例としては、ジクロロフェンおよびベンジルアルコールヘミホルマールなどがある。

【0171】

本発明に従って使用することができる種子被覆製剤中に存在させることができる二次増粘剤には、農薬組成物中でそのような目的で使用可能な全ての物質がある。セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサンタン、改質粘土および微粉碎シリカが好ましい。

【0172】

本発明に従って使用することができる種子被覆製剤中に存在させることができる粘着剤には、種子被覆製品で使用可能な全ての一般的な結合剤がある。好ましいものとして、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコールおよびチロースを挙げることができる。

【0173】

本発明に従って使用することができる種子被覆製剤中に存在させることができるジベレリン類は、好ましくはジベレリンA1、A3(=ジベレリン酸)、A4およびA7であり、ジベレリン酸が特に好ましく使用される。ジベレリン類は公知である(R. Wegler Chemie der Pflanzenschutz- and Schaedlingsbekämpfungsmittel [Chemistry of Crop Protection Compositions and Pesticides], vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412参照)。

10

20

30

40

50

【0174】

本発明に従って用いることができる種子被覆製剤は、トランスジェニック植物の種子を含む非常に広範囲の種子を直接または水で希釈した後に処理するのに用いることができる。これに関連して、別の相乗効果も、発現によって形成される物質と協力して相乗効果が生じる可能性もある。

【0175】

従来種子被覆操作に用いることができる全ての混合物が、本発明に従って用いることができる種子被覆製剤で、または水を加えることでそれから調製される製剤で種子を処理するのに好適である。具体的には、種子被覆時に、種子を混合機に入れ、特定の望ましい量の種子被覆製剤をそれ自体でまたは水で事前に希釈した後に加え、製剤が種子上に均一に分布するまで全てを混合する手順に従う。適切であれば、それに続いて乾燥工程を行う。

10

【0176】

本発明による活性化化合物または組成物は、強い殺菌活性を有し、作物保護および材料保護において、真菌および細菌などの望ましくない微生物を防除するのに用いることができる。

【0177】

殺菌剤は、作物保護において、ネコバカビ類 (Plasmodiophomycetes)、卵菌類 (Oomycetes)、ツボカビ類 (Chytridiomycetes)、接合菌類 (Zygomycetes)、子囊菌類 (Ascomycetes)、担子菌類 (Basidiomycetes) および不完全菌類 (Deuteromycetes) の防除するのに用いることができる。

20

【0178】

殺細菌剤は、作物保護において、シュードモナス科 (Pseudomonadaceae)、リゾビウム科 (Rhizobiaceae)、腸内細菌科 (Enterobacteriaceae)、コリネバクテリウム科 (Corynebacteriaceae) およびストレプトミセス科 (Streptomycetaceae) の防除に用いることができる。

【0179】

本発明による殺菌剤組成物は、植物病原菌の治療的または保護的防除に用いることができる。従って本発明は、種子、植物または植物部分、果実またはその植物が成長する土壤に施用される本発明による活性化化合物もしくは組成物を用いて植物病原菌を治療的および保護的に防除する方法に関するものでもある。

30

【0180】

作物保護における植物病原菌を防除するための本発明による組成物は、有効だが非植物毒性の量の本発明による活性化化合物を含む。「有効だが、非植物毒性の量」とは、満足できる形で植物の真菌疾患を防止したり、真菌疾患を完全に根絶するのに十分であって、同時に植物毒性の症状をほとんど引き起こさない本発明による組成物の量を意味する。この施用量は、一般的には比較的広い範囲で変動し得るものである。それは複数の因子、例えば防除対照の真菌、植物、気候条件および本発明による組成物の成分によって決まる。

【0181】

活性化化合物が、植物病害の防除に必要な濃度で植物によって良好に耐受されることから、植物の地上部、栄養繁殖体および種子、ならびに土壤の処理を行うことができる。

40

【0182】

本発明に従って、全ての植物および植物部分を処理することができる。植物とは、本発明においては、望ましいおよび望ましくない野生植物または作物 (天然作物を含む。) のような全ての植物および植物集団を意味する。作物は、従来品種改良および至適化法によって、またはバイオテクノロジーおよび遺伝子工学法によって、またはこれらの方法の組み合わせによって得ることができる植物であることができ、遺伝子導入植物を含み、品種保護権利によって保護され得るまたは保護され得ない植物品種を含む。植物部分は、芽、葉、花および根のような、植物のあらゆる地上部および地下部および器官を意味するも

50

のと理解すべきであり、例として、葉、針葉、茎、幹、花、子実体、果実および種子、根、塊茎および地下茎を挙げることができる。植物部分には、収穫物ならびに栄養増殖物および生殖増殖物、例えば、切り枝、塊茎、地下茎、細片および種子などもある。

【0183】

本発明の活性化合物は、植物および植物の器官を保護するのに適しており、収穫高を高めるのに適しており、収穫作物の品質を高めるのに適していながら、植物によって良好に耐容され、好ましい恒温動物毒性を有し、環境に優しい。それらは好ましくは作物保護剤として用いることができる。それらは、通常は感受性および抵抗性の種に対してならびに発達の全段階もしくは一部の段階に対して有効である。

【0184】

本発明に従って処理可能な植物には、次の植物などがある。すなわち主要農作物：トウモロコシ、ダイズ、ワタ、アブラナ属油料種子 (*Brassica oilseeds*)、例えば、セイヨウアブラナ (*Brassica napus*) (例えば、カノラ)、カブ (*Brassica rapa*)、カラシナ (*B. juncea*) (例えば、(菜の花) マスタード) およびアビシニアガラシ (*Brassica carinata*)、イネ、コムギ、テンサイ、サトウキビ、エンパク、ライムギ、オオムギ、アワおよびモロコシ、ライコムギ、アマ、ブドウ、ならびに、種々の植物学的分類群に属するさまざまな果実および野菜、例えばバラ科属種 (*Rosaceae sp.*) (例えば、梨果果実、例えばリンゴおよびナシだけでなく、石果果実、例えば、アンズ、サクランボ、アーモンドおよびモモおよびベリー果物、例えばイチゴ)、リベシオイダ工科属種 (*Ribesioideae sp.*)、クルミ科属種 (*Juglandaceae sp.*)、カバノキ科属種 (*Betulaceae sp.*)、ウルシ科属種 (*Anacardiaceae sp.*)、ブナ科属種 (*Fagaceae sp.*)、クワ科属種 (*Moraceae sp.*)、モクセイ科属種 (*Oleaceae sp.*)、マタタビ科属種 (*Actinidiaceae sp.*)、クスノキ科属種 (*Lauraceae sp.*)、バショウ科属種 (*Musaceae sp.*) (例えば、バナナの木およびバナナ植林地)、アカネ科属種 (*Rubiaceae sp.*) (例えば、コーヒー)、ツバキ科属種 (*Theaceae sp.*)、アオギリ科属種 (*Sterculiaceae sp.*)、ミカン科属種 (*Rutaceae sp.*) (例えば、レモン、オレンジおよびグレープフルーツ)、ナス科属種 (*Solanaceae sp.*) (例えば、トマト、ジャガイモ、コショウ類、ナス)、ユリ科属種 (*Liliaceae sp.*)、キク科属種 (*Compositiidae sp.*) (例えば、レタス、チョウセンアザミおよびチコリー (これは、ルートチコリー (*root chicory*)、エンダイブまたはクニガナを包含する))、セリ科属種 (*Umbelliferae sp.*) (例えば、ニンジン、パセリ、セロリおよびセロリアック)、ウリ科属種 (*Cucurbitaceae sp.*) (例えば、キュウリ (これは、ガーキン類、カボチャ類、スイカ類、ヒョウタン類およびメロン類を包含する)、ネギ科属種 (*Alliaceae sp.*) (例えば、ネギおよびタマネギ)、アブラナ科各種 (*Cruciferae sp.*) (例えば、キャベツ、紫キャベツ、ブロッコリー、カリフラワー、芽キャベツ、青梗菜、コールラビ、ラディッシュ、セイヨウワサビ、クレソン、およびハクサイ)、マメ科各種 (*Leguminosae sp.*) (例えば、ラッカセイ、エンドウおよびマメ類 (例えば、インゲンマメおよびソラマメ))、アカザ科各種 (*Chenopodiaceae sp.*) (例えば、フダンソウ、飼料用ビート、ハウレンソウ、ビートの根 (*beet roots*))、アオイ科 (*Malvaceae*) (例えば、オクラ)、クサスギカズラ科 (*Asparagaceae*) (例えば、アスパラガス); 庭園および森林における有用な植物および観賞植物; そして各場合で、これら植物の遺伝子改変型である。

【0185】

すでに上述したように、本発明に従って、全ての植物および植物部分を処理することが可能である。好ましい実施形態では、野生植物種および植物栽培品種、または異種交配もしくはプロトプラスト融合のような従来 of 生物育種方法によって得られたもの、ならびに

10

20

30

40

50

これらの部分を処理する。さらに好ましい実施形態では、遺伝子工学、適切な場合は、従来の方法と組み合わせて得られた遺伝子導入植物および植物品種（遺伝的改変生物）、ならびにこれらの部分を処理する。「部分」、「植物の部分」または「植物部分」という用語については、すでに上記で説明している。より好ましくは、それぞれ市販されているが使用されている植物品種の植物を、本発明に従って処理する。植物品種とは、従来の品種改良、突然変異誘発または組換えDNA技術によって得られた、新規な特徴（「形質」）を有する植物を意味するものと理解される。これらは、栽培品種、変種、生物型または遺伝子型であることができる。

【0186】

本発明による処理方法は、遺伝子改変した生物（GMOs）、例えば、植物または種子の処理で使用することができる。遺伝子改変した植物（またはトランスジェニック植物）は、異種遺伝子がゲノム中に安定に組み込まれている植物である。「異種遺伝子」という表現は、本質的に、植物の外側で提供または組み立てられ、かつ、細胞核ゲノム、クロロプラストゲノムまたはミトコンドリアゲノムに導入すると、形質転換された植物に、対象となるタンパク質もしくはポリペプチドを発現することで、またはその植物に存在する他の遺伝子を低下またはサイレンシングすることにより（例えば、アンチセンス技術、共抑制技術またはRNAi干渉[RNAi]を用いる）、新たなもしくは改善された農学的その他の特性を与える遺伝子を意味する。ゲノム中に存在する異種遺伝子は、同様にトランス遺伝子と呼ばれる。植物のゲノム中でのその特定の位置によって定義されるトランス遺伝子は、形質転換またはトランスジェニック事象と呼ばれる。

【0187】

植物種または植物品種、それらの場所および成長条件（土壌、天候、生育期間、栄養）によっては、本発明の処理は、超加算的（「相乗」）効果をもたらすこともある。例えば、実際に起こると予想される効果を超える次の効果：施用量の低減および/または活性スペクトルの拡大および/または本発明に従って使用することができる活性化化合物および組成物の活性の向上、植物成長の改善、高温もしくは低温に対する耐性の向上、干魃または水もしくは土壌の塩含有量に対する耐性向上、開花能の向上、収穫の簡易化、成熟の加速、収穫高の増大、より大きい果実、より高い植物、より濃い緑色の葉、より容易な開花、収穫物の品質向上および/または栄養価の上昇、収穫物の保存安定性および/または加工性の向上が可能となる。

【0188】

一定の施用量では、本発明による活性化化合物は、植物における増強効果を有する可能性もある。したがって、それらは、望ましくない植物病原菌類および/または微生物および/またはウイルスによる攻撃に対する植物の防御システムの動員に適している。これは、適切であれば、例えば真菌に対する本発明による組み合わせの向上した活性の理由の一つであり得る。植物増強性（抵抗性誘発性）物質は、本願の関連において、続いて望ましくない植物病原菌を接種された場合に、処理される植物が、かなりの程度の望ましくない植物病原菌に対する抵抗性を示すように植物の防御システムを刺激することができる物質または物質の組み合わせも意味するものと理解すべきである。したがって、本発明による物質は、処理後のある一定の時間内に、上記病原体による攻撃に対して植物を保護するのに使用できる。保護がもたらされる期間は、活性化化合物で植物を処理してから、一般には1から10日間、好ましくは1から7日間に及ぶ。

【0189】

好ましくは本発明により処理されるべき植物および植物品種には、その植物（育種および/またはバイオテクノロジー的手段によって得られたか否かとは無関係に）に特に有利で有用な形質を付与する遺伝物質を有する全ての植物が含まれる。

【0190】

やはり好ましくは本発明により処理される植物および植物品種は、1以上の生物ストレス因子に対して抵抗性である。すなわち、その植物は、例えば線虫、昆虫、ダニ、植物病原菌、細菌、ウイルスおよび/またはウィロイドなどの有害動物および有害微生物に対す

るより良好な防御を有する。

【0191】

線虫抵抗性植物の例は、例えば下記の米国特許出願 11/765,491、11/765,494、10/926,819、10/782,020、12/032,479、10/783,417、10/782,096、11/657,964、12/192,904、11/396,808、12/166,253、12/166,239、12/166,124、12/166,209、11/762,886、12/364,335、11/763,947、12/252,453、12/209,354、12/491,396および12/497,221に記載されている。

【0192】

やはり本発明に従って処理可能な植物および植物品種は、1以上の非生物ストレス因子に対して抵抗性である植物である。非生物ストレス条件には、例えば、乾燥、低温曝露、熱曝露、浸透圧ストレス、浸水、土壌塩濃度上昇、ミネラル曝露増加、オゾン曝露、強露光、窒素栄養素利用能の制限、リン栄養素利用能の制限または日陰の忌避などがあり得る。

【0193】

やはり本発明に従って処理することができる植物および植物品種は、収穫特性改善を特徴とする植物である。例えば改善された植物の生理、改善された植物の成長および発達、例えば水利用効率、水保持効率、窒素利用の改善、炭素同化向上、光合成向上、発芽効率上昇および成熟加速の結果、これら植物での収量増加につながり得る。収量はさらに、改善された植物構造（ストレス条件および非ストレス条件下）によって影響され得るものであり、それには、早期開花、ハイブリッド種子製造のための開花制御、苗の元気、植物の大きさ、節間の数および間隔、根の成長、種子の大きさ、果実の大きさ、鞘の大きさ、鞘および穂の数、鞘または穂当たりの種子数、種子の質量、種子充填度の強化、種子裂開の低減、減少した鞘裂開の低減および倒伏耐性などがある。さらなる収量関係の形質には、種子組成、例えば炭水化物含有量、タンパク質含有量、油の含有量および組成、栄養価、非栄養化合物の減少、加工性改善および貯蔵安定性の向上などがある。

【0194】

本発明により処理され得る植物は、既にヘテロシスまたはハイブリッド効果の特徴を発現するハイブリッド植物であり、それによって、収量、活力、健康および生物ストレスおよび非生物ストレス因子に対する抵抗性がより高くなる。そのような植物は代表的には、同系交配雄性不稔親株（雌親）と別の同系交配雄性稔性親株（雄親）を交雑させることにより作られる。ハイブリッド種子は代表的には、雄性不稔植物から収穫され、栽培者に販売される。雄性不稔植物は、（例えばトウモロコシでは）、雄穂除去、すなわち雄性生殖器官（または雄花）の物理的除去により作ることができる場合があるが、より代表的には、雄性不稔性が、植物ゲノムにおける遺伝的決定基の結果となる。この場合、そして特に種子がハイブリッド植物から収穫するのが望まれる産物である場合に、雄性不稔性の原因となる遺伝的決定因子を含むハイブリッド植物での雄性不稔性が十分に回復されるようにすることが有用であるのが普通である。これは、雄性不稔性を担う遺伝的決定基を含むハイブリッド植物で雄性稔性を回復することができる適切な稔性回復遺伝子を雄親が有するようにより達成される。雄性不稔性の遺伝的決定基は細胞質に局在化していることができる。細胞質雄性不稔性（CMS）の例としては、例えばアブラナ種に記載されていた。しかしながら、雄性不稔性の遺伝的決定基は、細胞核ゲノムに局在化していることもできる。雄性不稔性植物は、遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によっても得ることができる。雄性不稔性植物を得る上で特に好ましい手段は、WO89/10396に記載されており、そこでは、例えば、バルナーゼなどのリボヌクレアーゼが、雄しべにあるタペータム細胞で選択的に発現される。次に稔性は、バルスターなどのリボヌクレアーゼ阻害剤のタペータム細胞での発現によって回復することができる。

【0195】

本発明によって処理することができる植物または植物品種（遺伝子工学などの植物バイ

10

20

30

40

50

オテクノロジー法によって得られる)は、除草剤耐性植物、すなわち、1以上の所定の除草剤に対して耐性とされた植物である。そのような植物は、形質転換により、またはそのような除草剤耐性を付与する突然変異を含む植物の選択によって得ることができる。

【0196】

除草剤耐性植物は、例えばグリホセート耐性植物、すなわち除草剤であるグリホセートまたはその塩に対して耐性とされた植物である。植物は、各種方法によってグリホセートに対して耐性とすることができる。例えば、グリホセート耐性植物は、酵素5-エノールピルビルシキマート-3-ホスファート合成酵素(EPSPS)をコードする遺伝子で植物を形質転換することで得ることができる。そのようなEPSPS遺伝子の例は、細菌サルモネラ・チフィムリウム(*Salmonella typhimurium*)のAroA遺伝子(突然変異CT7)(Comai et al., 1983, Science 221, 370-371)、細菌アグロバクテリウム属種(*Agrobacterium* sp)のCP4遺伝子(Barry et al., 1992, Curr. Topics Plant Physiol. 7, 139-145)、ペチュニアEPSPS(Shah et al., 1986, Science 233, 478-481)、トマトEPSPS(Gasser et al., J. Biol. Chem. 263, 4280-4289)もしくはオヒシバ(*Eleusine*)EPSPS(WO01/66704)をコードする遺伝子である。それは、変異EPSPSであることもできる。グリホセート耐性植物は、グリホセートオキシド-レダクターゼ酵素をコードする遺伝子を発現させることによって得ることもできる。グリホセート耐性植物は、グリホセートアセチルトランスフェラーゼ酵素をコードする遺伝子を発現させることによって得ることもできる。グリホセート耐性植物は、上述の遺伝子の天然突然変異を含む植物を選択することによっても得ることができる。グリホセート耐性をもたらずEPSPS遺伝子を発現する植物が報告されている。グリホセート耐性をもたらず他の遺伝子、例えばデカルボキシラーゼ遺伝子を発現する植物が報告されている。

10

20

30

40

50

【0197】

他の除草剤耐性植物は、例えば酵素であるグルタミン合成酵素を阻害する除草剤、例えばピアラホス、ホスフィノトリシンまたはグルホシネートに対して耐性とされた植物である。そのような植物は、除草剤を解毒する酵素または阻害に対して耐性である酵素グルタミン合成酵素の突然変異体を発現させることによって得ることができる。一つのそのような有効な解毒性酵素は例えば、ホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼ(例えば、ストレプトミセス(*Streptomyces*)種からのbarまたはpatタンパク質など)をコードする酵素である。外来ホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼを発現する植物も記載されている。

【0198】

さらに別の除草剤耐性植物は、酵素ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)を阻害する除草剤に対して耐性にされている植物でもある。ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼは、パラヒドロキシフェニルピルビン酸(HPP)がホモゲンチジン酸に変換される反応を触媒する酵素である。WO96/38567、WO99/24585、WO99/24586、WO2009/144079、WO2002/046387またはUS6,768,044に記載のように、天然の耐性HPPD酵素をコードする遺伝子または突然変異もしくはキメラHPPD酵素をコードする遺伝子を用いて、HPPD阻害剤に対して耐性の植物を形質転換することができる。HPPD阻害剤に対する耐性はまた、HPPD阻害剤による天然HPPD酵素の阻害にもかかわらずホモゲンチジン酸の形成を可能にする、ある種の酵素をコードする遺伝子を用いて植物を形質転換することによっても得ることができる。そのような植物は、WO99/34008およびWO02/36787に記載されている。WO2004/024928に記載のように、HPPD耐性酵素をコードする遺伝子に加えて、プレフェン酸デヒドロゲナーゼをコードする遺伝子を用いて植物を形質転換することによって、HPPD阻害剤に対する植物の耐性を改善させることもできる。さらに、植物のゲノムに、HPPD阻害薬を代謝もしくは分解

する酵素、例えばCYP450酵素をコードする遺伝子を挿入することで、植物を、HPD阻害薬に対してより耐性の高いものとすることができる(WO2007/103567およびWO2008/150473参照)。

【0199】

さらに別の除草剤抵抗性植物は、アセト乳酸合成酵素(ALS)阻害剤に対して耐性とされた植物である。公知のALS阻害剤には、例えばスルホニル尿素、イミダゾリノン、トリアゾピリミジン類、プリミジニルオキシ(チオ)安息香酸化合物および/またはスルホニルアミノカルボニルトリアゾリノン系除草剤などがある。例えば、Tranel and Wright (Weed Science 2002, 50, 700-712)に記載のように、ALS酵素(アセトヒドロキシ酸合成酵素、AHASとも称される)における各種突然変異が、各種の除草剤または除草剤群に対する耐性を付与することが知られている。スルホニル尿素耐性植物およびイミダゾリノン耐性植物の製造は既報である。さらに別のスルホニル尿素およびイミダゾリノン耐性植物も報告されている。

10

【0200】

イミダゾリノンおよび/またはスルホニル尿素に対して耐性である別の植物は、突然変異誘発により、除草剤存在下での細胞培地での選別により、または突然変異育種によって得ることができる(例えば、ダイズについては、US5084082、イネについてはWO97/41218、サトウダイコンについてはUS5773702およびWO99/057965、レタスについてはUS5198599、またはヒマワリについてはWO01/065922参照)。

20

【0201】

やはり本発明に従って処理することができる植物または植物品種(遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られる)は、昆虫耐性トランスジェニック植物、すなわち、ある種の標的昆虫による攻撃に対して耐性とした植物である。そのような植物は、形質転換によってまたはそのような昆虫耐性を付与する突然変異を含む植物の選択によって得ることができる。

【0202】

本発明の文脈において、「昆虫耐性トランスジェニック植物」という用語には、次のものをコードするコード配列を含む少なくとも一つのトランス遺伝子を含む植物などがある。

30

【0203】

1) バチルス・チューリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)由来の殺虫性結晶タンパク質またはその殺虫性部分、例えばバチルス・チューリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)毒命名法においてCrickmoreら(2005)によって改訂されたCrickmore et al. (*Microbiology and Molecular Biology Reviews* 1998, 62, 807-813)、オンライン:http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/)にオンラインでまとめられた殺虫性結晶タンパク質またはその殺虫性部分、例えばCryタンパク質分類Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1B、Cry1C、Cry1D、Cry1F、Cry2Ab、Cry3AaまたはCry3Bbのタンパク質またはそれらの殺虫性部分(例えばEP-A1999141およびWO2007/107302)、または米国特許出願12/249,016に記載の合成遺伝子によってコードされるタンパク質;または

40

2) バチルス・チューリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)由来の結晶タンパク質またはバチルス・チューリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)以外の第二の結晶タンパク質またはその部分の存在下で殺虫性であるその部分、例えばCry34およびCry35結晶タンパク質から構成される二元毒素(Nat. Biotechnol. 2001, 19, 668-72; Applied Environm. Microbiol. 2006, 71, 17

50

65-1774) または Cry 1 A もしくは Cry 1 F タンパク質、および Cry 2 A a もしくは Cry 2 A b または Cry 2 A e タンパク質からなる二元毒素 (米国特許出願 12/214,022 および EP 08010791.5); または

3) パチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 由来の 2 つの異なる殺虫性結晶タンパク質の部分を含むハイブリッド殺虫性タンパク質、例えば、上記 1) のタンパク質のハイブリッドまたは上記 2) のタンパク質のハイブリッド、例えば、コーン・イベント (corn event) MON 98034 により産生される Cry 1 A . 105 タンパク質 (WO 2007/027777); または

4) 標的昆虫種に対するより高い殺虫活性を得るために、および/または、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するために、および/またはクローニングもしくは形質転換時にコード DNA で誘発される変化のために、いくつか、特に 1 から 10 のアミノ酸が別のアミノ酸により置換されている上記項目 1) から 3) のいずれか一つのタンパク質、例えばコーン・イベント MON 863 または MON 88017 における Cry 3 B b 1 タンパク質またはコーン・イベント MIR 604 における Cry 3 A タンパク質; または

5) パチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) またはパチルス・セレウス (*Bacillus cereus*) 由来の殺虫性分泌タンパク質またはその殺虫性部分、例えば http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html で列挙される植物殺虫性タンパク質 (VIP)、例えば、VIP 3 A a タンパク質分類からのタンパク質; または

6) パチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) または B . セレウス (*B. cereus*) 由来の第二の分泌タンパク質存在下で殺虫性であるパチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) またはパチルス・セレウス (*Bacillus cereus*) 由来の分泌タンパク質、例えば、VIP 1 A および VIP 2 A タンパク質から構成される二元毒素 (WO 94/21795); または

7) パチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) またはパチルス・セレウス (*Bacillus cereus*) 由来の異なる分泌タンパク質からの部分を含むハイブリッド殺虫性タンパク質、例えば上記 1) におけるタンパク質のハイブリッドまたは上記 2) におけるタンパク質のハイブリッド; または

8) 標的昆虫種に対するより高い殺虫活性を得るために、および/または、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するために、および/またはクローニングもしくは形質転換時にコード DNA で誘発される変化のために、いくつか、特に 1 から 10 のアミノ酸が別のアミノ酸により置換されている上記項目 5) から 7) のいずれかのタンパク質 (なおも殺虫性タンパク質をコードしている)、例えば、コットン・イベント COT 102 における VIP 3 A a タンパク質; または

9) パチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) からの結晶タンパク質の存在下に殺虫性であるパチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) またはパチルス・セレウス (*Bacillus cereus*) からの分泌タンパク質、例えば、タンパク質 VIP 3 および Cry 1 A または Cry 1 F から構成される二元毒素 (米国特許出願 61/126083 および 61/195019)、または VIP 3 タンパク質および Cry 2 A a または Cry 2 A b または Cry 2 A e タンパク質から構成される二元毒素 (米国特許出願 12/214,022 および EP 08010791.5); または

10) いくつかの、特に 1 から 10 個のアミノ酸が別のアミノ酸によって置き換わっていることで、標的昆虫種に対するより高い殺虫活性が得られ、および/または影響を受ける標的昆虫種の範囲が拡大されており、および/またはクローニングまたは形質転換時のコード DNA で誘発される変化 (なおも、殺虫性タンパク質はコードしている) がある上記の項目 9) によるタンパク質。

【0204】

10

20

30

40

50

当然のことながら、本明細書で使用される場合の昆虫耐性トランスジェニック植物には、上記の分類1から10のいずれか一つのタンパク質をコードする遺伝子の組み合わせを含む植物が含まれる。1実施態様において、昆虫耐性植物は、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するため、または同じ標的昆虫種に対して殺虫性があるが異なる作用機序（例えば、昆虫での異なる受容体結合部位に結合する等）を有する異なるタンパク質を使用することによって植物に対する昆虫の抵抗性発達を遅延させるために、上記の分類1から10のいずれか一つのタンパク質をコードする複数のトランス遺伝子を含む。

【0205】

本発明の文脈において、「昆虫耐性トランスジェニック植物」はさらに、有害昆虫による食物の摂取後に、その有害生物の成長を防止する二本鎖RNAの産生のための配列を含む少なくとも一つの導入遺伝子を含む植物を包含するものである。

10

【0206】

やはり本発明によって処理することができる植物または植物品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得たもの）は、非生物ストレス因子に対して耐性である。そのような植物は、形質転換によりまたはそのようなストレス耐性を付与する突然変異を含む植物の選択によって得ることができる。特に有用なストレス耐性植物には以下のものなどがある。

【0207】

a. 植物細胞または植物においてポリ（ADP-リボース）ポリメラーゼ（PARP）遺伝子の発現および/または活性を低下させることができるトランス遺伝子を含む植物、

20

b. 植物または植物細胞のPARGコード遺伝子の発現および/または活性を低下させることができるストレス耐性促進トランス遺伝子を含む植物、

c. ニコチンアミダーゼ、ニコチネートホスホリボシルトランスフェラーゼ、ニコチン酸モノヌクレオチドアデニルトランスフェラーゼ、ニコチンアミドアデニンジヌクレオチド合成酵素またはニコチンアミドホスホリボシルトランスフェラーゼなどのニコチンアミドアデニンジヌクレオチドサルベージ生合成経路の植物機能性酵素をコードするストレス耐性促進トランス遺伝子を含む植物。

【0208】

やはり本発明によって処理することができる植物または植物品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得たもの）は、収穫産物の量、品質および/または貯蔵安定性の変化および/または収穫産物の具体的な成分の特性変化も示し、それには下記のものなどがある。

30

【0209】

1) 物理化学的特性、特にアミロース含有量またはアミロース/アミロペクチン比、分枝度、平均鎖長、側鎖分布、粘性挙動、ゲル強度、デンプンの粒度および/または粒子形態に関して、野生型植物細胞または植物で合成されるデンプンと比較して変化していることで、ある種の用途により適したものとなる改質デンプンを合成するトランスジェニック植物、

2) 非デンプン炭水化物ポリマーを合成する、または遺伝子組み換えなしに野生型植物と比較して特性が変わっている非デンプン炭水化物ポリマーを合成するトランスジェニック植物。例としては、特にイヌリン型およびレバン型のポリフルクトースを産生する植物、 α -1,4-グルカン類を産生する植物、 α -1,6-分枝 α -1,4-グルカン類を産生する植物、およびアルテルナンを産生する植物がある。

40

【0210】

3) ヒアルロン酸を産生するトランスジェニック植物。

【0211】

4) 「高い可溶性固体含有量」、「低い辛味」（LP）および/または「長い貯蔵期間」（LS）などの特定の特性を有するタマネギなどのトランスジェニック植物もしくは交配植物。

【0212】

50

やはり本発明によって処理することができる植物または植物品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得たもの）は、繊維特性が変化したワタ植物などの植物である。そのような植物は、形質転換によりまたはそのような繊維特性を変化させる突然変異を含む植物の選択により得ることができ、それには下記のものなどがある。

【0213】

- a) 改変型のセルロース合成酵素遺伝子を含むワタ植物などの植物、
- b) 改変型の *rsw2* または *rsw3* 相同性核酸を含むワタ植物などの植物、例えばシヨ糖リン酸合成酵素の発現が高くなったワタ植物、
- c) シヨ糖リン酸合成酵素の発現が高くなったワタ植物などの植物、
- d) 繊維細胞の根底での原形質連絡制御のタイミングが、例えば繊維選択的 - 1, 3 - グルカナーゼの低下によって変化しているワタ植物などの植物、
- e) 例えば *nodC* などの N - アセチルグルコサミントランスフェラーゼ遺伝子およびキチン合成遺伝子の発現により、反応性が変わった繊維を有するワタ植物などの植物。

10

【0214】

やはり本発明によって処理することができる植物または植物品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得たもの）は、油分プロファイルの特徴が変わったセイヨウアブラナまたは関連するアブラナ (*Brassica*) 植物などの植物である。そのような植物は、形質転換によりまたはそのような油分の特徴を変える突然変異を含む植物の選択によって得ることができ、それには下記のものなどがある。

20

【0215】

- a) 高いオレイン酸含有量を有する油を産生するセイヨウアブラナ植物などの植物；
- b) 低いリノレン酸含有量を有する油を産生するセイヨウアブラナ植物などの植物；
- c) 低レベルの飽和脂肪酸を有する油を産生するセイヨウアブラナ植物などの植物。

【0216】

やはり本発明に従って処理可能である植物または植物栽培品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られる）は、例えばジャガイモウィルス Y (*Techno plant*, *Argentina* からの SY230 および SY233 事象) に対してウィルス抵抗性である、またはジャガイモ葉枯れ病などの病害に対して抵抗性である（例えば RB 遺伝子）、または低温誘発甘味化の低下を示す（遺伝子 *Nt-Inh*、*II-INV* を有する）、または萎縮表現型を示す（A-20 オキシダーゼ遺伝子）ジャガイモなどの植物である。

30

【0217】

やはり本発明に従って処理可能である植物または植物栽培品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られる）は、種子脱粒特性が変わったアブラナまたは関連するアブラナ属植物などの植物である。そのような植物は、形質転換により、またはそのような変化した特性を与える突然変異を含む植物を選択することで得ることができ、種子脱粒特性の変化などを与える突然変異を含み、種子脱粒が遅延または低減するアブラナなどの植物などがある。

【0218】

本発明に従って処理できる特に有用なトランスジェニック植物は、米国において米国農務省 (USDA) の動植物衛生検査部 (APHIS) で未規制状態についての認可されたもしくは係属中の申し立ての主題である形質転換事象または形質転換事象の組み合わせを有する植物である。これに関する情報は常に、例えばウェブサイト http://www.aphis.usda.gov/brs/not_reg.html を介して APHIS (4700 River Road Riverdale, MD 20737, USA) から入手できる。本願の出願日に、下記の情報を含む申し立てが、APHIS で認可されたか係属中であった。

40

【0219】

- 申し立て：申し立ての識別番号。形質転換事象の技術的説明は、申し立て番号を介してウェブサイト APHIS から得ることができる特定の申立文書にある。それらの記載

50

は、参照によって本明細書に組み込まれる。

【0220】

- 申し立ての延長：範囲もしくは期間の延長が申請されている過去の申し立てについての言及。

【0221】

- 機関：申し立てを提出する者の名称。

【0222】

- 規制条項：関係する植物種。

【0223】

- トランスジェニック表現型：形質転換事象によって植物に与えられる形質。

10

【0224】

- 形質転換事象または系統：未規制状態が要求されている事象（場合により、系統とも称される）の名称。

【0225】

- APHIS文書：申し立てに関連してAPHISによって刊行されているか、請求によりAPHISから得ることができる各種文書。

【0226】

本発明によって処理することができる特に有用なトランスジェニック植物は、1以上の毒素をコードする1以上の遺伝子を有する植物であり、次の商品名YIELD GARD（登録商標）（例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ）、KnockOut（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、BiteGard（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Bt-Extra（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、StarLink（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Bollgard（登録商標）（ワタ）、Nucotn（登録商標）（ワタ）、Nucotn 33B（登録商標）（ワタ）、NatureGard（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Protecta（登録商標）およびNewLeaf（登録商標）（ジャガイモ）で入手可能なトランスジェニック植物である。挙げるべき除草剤耐性植物の例には、次の商品名Roundup Ready（登録商標）（グリホセート耐性、例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ）、Liberty Link（登録商標）（ホスフィノトリシン耐性、例えば、セイヨウアブラナ）、IMI（登録商標）（イミダゾリノン類耐性）およびSCS（登録商標）（スルホニル尿素耐性、例えばトウモロコシ）で販売されているトウモロコシ品種、ワタ品種およびダイズ品種がある。挙げるすることができる除草剤耐性植物（除草剤耐性となるよう従来の方法で育種された植物）には、Clearfield（登録商標）の名称（例えばトウモロコシ）で販売されている品種などがある。

20

30

【0227】

本発明により処理することができる特に有用なトランスジェニック植物は、形質転換事象または形質転換事象の組み合わせを含む植物であり、それは例えば各種の国または地域の規制当局からのデータベースに列記されたものである（例えば、<http://cera-gmc.org/link/index.php?evidcode=&hs+IOXCode=&gType=&AbbrCode=&atCode=&stCode=&coIDCode=&action=gm-crop-database&mode=Submit>およびhttp://gmoinfo.jrc.IT/gmp_browse.aspxを参照する）。

40

【0228】

さらに、材料保護において、本発明による活性化合物または組成物を、望ましくない微生物、例えば真菌および昆虫による攻撃および破壊に対して工業材料を保護するのに用いることができる。

【0229】

さらに本発明の化合物は、単独でまたは他の活性化合物と組み合わせて、防汚剤組成物として用いることができる。

50

【0230】

本発明の文脈での工業材料は、工業用に作られた非生物材料を意味するものと理解すべきである。例えば、本発明による活性化合物によって微生物による変化または破壊から保護されるべき工業材料は、接着剤、サイズ、紙、壁紙およびボール紙、テキスタイル、カーペット、皮革、木材、塗料およびプラスチック品、冷却潤滑剤および微生物によって感染もしくは破壊を受け得る他の材料である。微生物の繁殖によって害を受け得る製造工場および建物の一部、例えば冷却水循環路、冷却および加熱システムおよび換気および空調ユニットも、保護されるべき材料の範囲内と言及され得るものである。本発明の範囲内の工業材料には好ましくは、接着剤、サイズ、紙および板、皮革、木材、塗料、冷却潤滑剤および熱伝達液などがあり、より好ましいものは木材である。本発明による活性化合物または組成物は、腐敗、劣化、退色、脱色またはかび形成のような不利な作用を防止することができる。さらに、本発明による化合物は、海水または汽水と接触する物品、特に船体、篩、ネット、建築物、係留所および信号システムを汚染に対して保護するのに用いることができる。

10

【0231】

望ましくない真菌を防除するための本発明による方法は、貯蔵品保護にも用いることができる。ここで、貯蔵品とは、長期間の保護が望まれる植物もしくは動物起源の天然物質または天然起源のその加工製品を意味するものと理解されるべきである。例えば植物もしくは植物部分などの植物由来の貯蔵品、例えば茎、葉、塊茎、種子、果実、穀粒は、収穫されたばかりで、または（前）乾燥、加湿、破碎、粉碎、加圧または焙焼による加工形態後に保護することができる。貯蔵品には、建築用材木、電柱および柵などの粗材木または家具などの完成製品の形態の材木との両方も含まれる。動物由来の貯蔵品は、例えば獣皮、皮革、毛皮および毛髪である。本発明による活性化合物は、腐食、劣化、変色、退色またはかび形成などの不利な作用を防ぐことができる。

20

【0232】

本発明に従って処理することができる真菌疾患の病原体の一部を例として挙げるができるが、これらに限定されるものでない。

【0233】

ウドンコ病の病原体によって引き起こされる病害、例えばブルメリア・グラミニス (*Blumeria graminis*) などのブルメリア (*Blumeria*) 種；ポドスファエラ・ロイコトリカ (*Podosphaera leucotricha*) などのポドスファエラ (*Podosphaera*) 種；スファエロセカ・フリギネア (*Sphaerotheca fuliginea*) などのスファエロセカ (*Sphaerotheca*) 種；ウンシヌラ・ネケータ (*Uncinula necator*) などのウンシヌラ (*Uncinula*) 種；

30

さび病病原体によって引き起こされる病害、例えばギムノスポランギウム・サピナエ (*Gymnosporangium sabiniae*) などのギムノスポランギウム (*Gymnosporangium*) 種；ヘミレイア・バスタトリックス (*Hemileia vastatrix*) などのヘミレイア (*Hemileia*) 種；ファコプソラ・パチライジ (*Phakopsora pachyrhizi*) およびファコプソラ・マイボミアエ (*Phakopsora meibomiaae*) などのファコプソラ (*Phakopsora*) 種；プッシニア・レコンディタ (*Puccinia recondita*) またはプッシニア・トリチシナ (*Puccinia triticina*) などのプッシニア (*Puccinia*) 種；ウロミセス・アッペンディキュラタス (*Uromyces appendiculatus*) などのウロミセス (*Uromyces*) 種；

40

卵菌類 (*Oomycetes*) 群の病原体によって引き起こされる病害、例えばブレミア・ラクチュカエ (*Bremia lactucae*) などのブレミア (*Bremia*) 種；ペロノスポラ・ピシ (*Peronospora pisi*) または *P. brassicae* などのペロノスポラ (*Peronospora*) 種；フィトフソラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*) などの

50

フィトフソラ (*Phytophthora*) 種; プラスモパラ・ビチコラ (*Plasmopara viticola*) などのプラスモパラ (*Plasmopara*) 種; シュードペロノスポラ・フムリ (*Pseudoperonospora humuli*) または シュードペロノスポラ・キューベンス (*Pseudoperonospora cubensis*) などのシュードペロノスポラ (*Pseudoperonospora*) 種; ピチウム・ウルティマム (*Pythium ultimum*) などのピチウム (*Pythium*) 種;

以下のものによって引き起こされる葉枯病 (*leaf blotch diseases*) および葉萎凋病 (*leaf wilt diseases*)、例えばアルテルナリア・ソラニ (*Alternaria solani*) などのアルテルナリア (*Alternaria*) 種; セルコスポラ・ベチコラ (*Cercospora beticola*) などのセルコスポラ (*Cercospora*) 種; クラジオスポリウム・キュキュメリナム (*Cladosporium cucumerinum*) などのクラジオスポリウム (*Cladosporium*) 種; コクリオボラス・サティブス (*Cochliobolus sativus*) (分生子型: ドレクスレラ (*Drechslera*)、同義語: ヘルミントスポリウム (*Helminthosporium*)) などのコクリオボラス (*Cochliobolus*) 種; コレトリカム・リンデムサニウム (*Colletotrichum lindemuthanium*) などのコレトリカム (*Colletotrichum*) 種; シクロコニウム・オレアギナム (*Cycloconium oleaginum*) などのシクロコニウム (*Cycloconium*) 種; ディアポルテ・シトリ (*Diaporthe citri*) などのディアポルテ (*Diaporthe*) 種; エルシノエ・フォーセッティイ (*Elsinoe fawcettii*) などのエルシノエ (*Elsinoe*) 種; グレオスポリウム・ラエティカラー (*Gloeosporium laeticolor*) などのグレオスポリウム種 (*Gloeosporium*); グロメラ・シングュラータ (*Glomerella cingulata*) などのグロメラ (*Glomerella*) 種; ギニャルディア・ビドウェリ (*Guignardia bidwellii*) などのギニャルディア (*Guignardia*) 種; レプトスファエリア・マキュランス (*Leptosphaeria maculans*) などのレプトスファエリア (*Leptosphaeria*) 種; マグナポルテ・グリージー (*Magnaporthe grisea*) などのマグナポルテ (*Magnaporthe*) 種; ミクロドチウム・ニバル (*Microdochium nivale*) などのミクロドチウム (*Microdochium*) 種; マイコスファエレラ・グラミニコラ (*Mycosphaerella graminicola*) および *M. fijiensis* などのマイコスファエレラ (*Mycosphaerella*) 種; フェオスファエリア・ノドラム (*Phaeosphaeria nodorum*) などのフェオスファエリア (*Phaeosphaeria*) 種; ピレノフォラ・テレス (*Pyrenophora teres*) などのピレノフォラ (*Pyrenophora*) 種; ラムラリア・コロシグニ (*Ramularia collo-cygni*) などのラムラリア (*Ramularia*) 種; リンコスポリウム・セカリス (*Rhynchosporium secalis*) などのリンコスポリウム (*Rhynchosporium*) 種; セプトリア・アピイ (*Septoria apii*) などのセプトリア (*Septoria*) 種; チフラ・インカルナータ (*Typhula incarnata*) などのチフラ (*Typhula*) 種; ベンチュリア・イナエキュアリス (*Venturia inaequalis*) などのベンチュリア (*Venturia*) 種;

以下のものによって引き起こされる根および茎の病害、例えばコルチシウム・グラミネアラム (*Corticium graminearum*) などのコルチシウム (*Corticium*) 種; フサリウム・オキシスポラム (*Fusarium oxysporum*) などのフサリウム (*Fusarium*) 種; ゲウマノミセス・グラミニス (*Gaeumannomyces graminis*) などのゲウマノミセス (*Gaeumannomyces*) 種; リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) などの

10

20

30

40

50

リゾクトニア (*Rhizoctonia*) 種; タペシア・アキュフォルミス (*Tapesia acuformis*) などのタペシア (*Tapesia*) 種; チエラビオプシス・バシコラ (*Thielaviopsis basicola*) などのチエラビオプシス (*Thielaviopsis*) 種;

以下のものによって引き起こされる穂および円錐花序の病害 (トウモロコシ穂軸など)、例えばアルテルナリア属 (*Alternaria* spp.) などのアルテルナリア (*Alternaria*) 種; アスペルギルス・フラバス (*Aspergillus flavus*) などのアスペルギルス (*Aspergillus*) 種; クラドスポリウム・クラドスポリオイデス (*Cladosporium cladosporioides*) などのクラドスポリウム (*Cladosporium*) 種; クラビセプス・パープレア (*Claviceps purpurea*) などのクラビセプス (*Claviceps*) 種; フサリウム・クルモラム (*Fusarium culmorum*) などのフサリウム (*Fusarium*) 種; ギッベレラ・ゼアエ (*Gibberella zeae*) などのギッベレラ (*Gibberella*) 種; モノグラフエラ・ニバリス (*Monographella nivalis*) などのモノグラフエラ (*Monographella*) 種; セプトリア・ノドラム (*Septoria nodorum*) などのセプトリア (*Septoria*) 種;

以下の黒穂菌 (smut fungi) によって引き起こされる病害、例えばスファセロセカ・ライリアナ (*Sphacelotheca reiliana*) などのスファセロセカ (*Sphacelotheca*) 種; ティレチア・カリエス (*Tilletia caries*)、*T. controversa* などのティレチア (*Tilletia*) 種; ウロシステイス・オキュラータ (*Urocystis occulta*) などのウロシステイス (*Urocystis*) 種; ウスティラゴ・ヌーダ (*Ustilago nuda*)、*U. nuda tritici* などのウスティラゴ (*Ustilago*) 種;

以下のものによって引き起こされる果実腐敗、例えばアスペルギルス・フラバス (*Aspergillus flavus*) などのアスペルギルス (*Aspergillus*) 種; ボトリティス・シネレア (*Botrytis cinerea*) などのボトリティス (*Botrytis*) 種; ペニシリウム・エクспанサム (*Penicillium expansum*) および *P. purpurogenum* などのペニシリウム (*Penicillium*) 種; スクレロティニア・スクレロティオラム (*Sclerotinia sclerotiorum*) などのスクレロティニア (*Sclerotinia*) 種; ベルティシリウム・アルボアトラム (*Verticillium albo-atrum*) などのベルティシリウム (*Verticillium*) 種;

以下のものによって引き起こされる種子および土壌伝染性の腐敗病および枯れ病ならびに苗の病害、例えばフサリウム・カルモラム (*Fusarium culmorum*) などのフサリウム (*Fusarium*) 種; フィトフソラ・カクトラム (*Phytophthora cactorum*) などのフィトフソラ (*Phytophthora*) 種; ピチウム・ウルティマム (*Pythium ultimum*) などのピチウム (*Pythium*) 種; リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) などのリゾクトニア (*Rhizoctonia*) 種; スクレロティウム・ロルフシイ (*Sclerotium rolfsii*) などのスクレロティウム (*Sclerotium*) 種;

以下のものによって引き起こされる癌性病害、こぶ病およびてんぐ巢病、例えばネクトリア・ガリゲナ (*Nectria galligena*) などのネクトリア (*Nectria*) 種;

以下のものによって引き起こされる枯れ病、例えばモニリニア・ラクサ (*Monilinia laxa*) などのモニリニア (*Monilinia*) 種;

以下のものによって引き起こされる葉、花および果実の奇形、例えばタフリナ・デフォルマンズ (*Taphrina deformans*) などのタフリナ (*Taphrina*) 種;

10

20

30

40

50

以下のものによって引き起こされる木材植物の変性病、例えばファエモニエラ・クラミドスポラ (*Phaemoniella clamydospora*) およびファエオアクレモニウム・アレオフィラム (*Phaeoacremonium aleophilum*) およびフォミチポリタ・メジテラネア (*Fomitiporia mediterranea*) などのエスカ (*Esca*) 種；

以下のものによって引き起こされる花および種子の病害、例えばボトリティス・シネレア (*Botrytis cinerea*) などのボトリティス (*Botrytis*) 種；

以下のものによって引き起こされる植物塊茎の病害、例えばリゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) などのリゾクトニア (*Rhizoctonia*) 種；ヘルミントスポリウム・ソラニ (*Helminthosporium solani*) などのヘルミントスポリウム (*Helminthosporium*) 種；

下記のような細菌性病原体によって引き起こされる病害、例えばキサントモナス・キャンペストリス *pv.* オリザエ (*Xanthomonas campestris pv. oryzae*) などのキサントモナス (*Xanthomonas*) 種；シュードモナス・シリングアエ *pv.* ラクリマンズ (*Pseudomonas syringae pv. lachrymans*) などのシュードモナス (*Pseudomonas*) 種；エルウィニア・アミロボラ (*Erwinia amylovora*) などのエルウィニア (*Erwinia*) 種。

【0234】

下記の大豆病害を防除することが好ましい。

【0235】

以下のものによって引き起こされる葉、茎、鞘および種子に対する真菌病害、例えばアルテルナリア葉斑点病 (*Alternaria leaf spot*) (アルテルナリア属種アトランス・テニュイッシマ (*Alternaria spec. atrans tenuissima*))、炭疽病 (コレトトリカム・グロエオスポロイデス・デマティウム亜種トランケイタム (*Colletotrichum gloeosporoide s dematium var. truncatum*))、褐斑病 (*brown spot*) (セプトリア・グリシネス (*Septoria glycines*))、セルコスポラ葉斑点病 (*cercospora leaf spot*) および焼枯れ病 (*blight*) (セクロスポラ・キクチイ (*Cercospora kikuchii*))、コアネフォラ葉焼枯れ病 (*choanephora leaf blight*) (コアネフォラ・インファンディブリスポラ・トリスポラ (*Choanephora infundibulifera trispora*) (同義))、ダクチュリオフォラ葉斑点病 (*dactuliophora leaf spot*) (ダクチュリオフォラ・グリシネス (*Dactuliophora glycines*))、べと病 (*downy mildew*) (ペロノスポラ・マンシュリカ (*Peronospora manshurica*))、ドレクスレラ焼枯れ病 (*drechslera blight*) (ドレクスレラ・グリシニ (*Drechslera glycini*))、葉輪紋病 (*frogeye leaf spot*) (セルコスポラ・ソジナ (*Cercospora sojae*))、レプトスファエルリナ葉斑点病 (*leptosphaerulina leaf spot*) (レプトスファエルリナ・トリフォリイ (*Leptosphaerulina trifolii*))、フィロスティカ葉斑点病 (*phyllostica leaf spot*) (フィロスティカ・ソジャエコラ (*Phyllosticta sojaecola*))、鞘および茎の焼枯れ病 (フォモプシス・ソジャエ (*Phomopsis sojae*))、うどんこ病 (*powdery mildew*) (ミクロスファエラ・ディフューザ (*Microsphaera diffusa*))、ピレノチャエタ葉斑点病 (*pyrenochaeta leaf spot*) (ピレノチャエタ・グリシネス (*Pyrenochaeta glycines*))、リゾクトニア・エリアル (*rhizoctonia aerial*)、葉および膜の焼枯れ病 (リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*))、さび病 (ファコブソラ・パチライジ (*Phakopso*

10

20

30

40

50

ra pachyrhizi)、ファコブソラ・メイドミエ(Phakopsora meidomiaae)、黒星病(スファセロマ・グリシネス(Sphaceloma glycines))、ステムフィリウム葉焼枯れ病(stemphylium leaf blight)(ステムフィリウム・ボトリオサム(Stemphylium botryosum))、輪紋病(コリネスボラ・カッシイコラ(Corynespora cassiicola))。

【0236】

下記のものによって引き起こされる根および茎基部の真菌病、例えば黒根腐病(black root rot)(カロネクトリア・クロタリアエ(Calonectria crotalariae))、炭腐病(マクロフォミナ・ファセオリナ(Macrophomina phaseolina))、フザリウム焼枯病(fusarium blight)または萎凋病(wilt)、根腐れ病ならびに鞘および頸部腐れ病(rot)(フザリウム・オキシスポラム(Fusarium oxysporum)、フザリウム・オルトセラス(Fusarium orthoceras)、フザリウム・セミテクタム(Fusarium semitectum)、フザリウム・エキセイチ(Fusarium equiseti)、マイコレプトディスカス根腐れ病(mycoleptodiscus root rot)(マイコレプトディスカス・テレストリス(Mycol eptodiscus terrestris))、ネオコスモスポラ(neocosmospora)(ネオコスモスポラ・バスイنفクタ(Neocosmopspora vasinfecta))、鞘および茎の焼枯病(blight)(ディアボルセ・ファセオロラム(Diaporthe phaseolorum))、枝枯れ病(ディアボルセ・ファセオロラム亜種カウリボラ(Diaporthe phaseolorum var. caulivora))、フィトフトラ腐れ病(phytophthora rot)(フィトフトラ・メガスペルマ(Phytophthora megasperma))、褐色茎腐れ病(brown stem rot)(フィアロフォラ・グレガータ(Phialophora gregata))、ピチウム腐れ病(pythium rot)(ピチウム・アフアニデルマトム(Pythium aphanidermatum))、ピチウム・イレギュラーレ(Pythium irregulaere)、ピチウム・デバリアナム(Pythium debaryanum)、ピチウム・ミリオチラム(Pythium myriotylum)、ピチウム・ウルティマム(Pythium ultimum))、リゾクトニア根腐れ病(rhizoctonia root rot)、茎腐敗および立枯病(リゾクトニア・ソラニ(Rhizoctonia solani))、スクレロティニア茎腐敗病(sclerotinia stem decay)(スクレロティニア・スクレロティオラム(Sclerotinia sclerotiorum))、スクレロティニア白絹病(sclerotinia Southern blight)(スクレロティニア・ロルフシイ(Sclerotinia rolfsii))、チエラビオプシス根腐れ病(thielaviopsis root rot)(チエラビオプシス・バシコラ(Thielaviopsis basicola))。

【0237】

工業材料の劣化または変化を生じさせ得る生物には、例えば細菌、真菌、酵母、藻類および粘液生物などがある。本発明による活性化化合物は好ましくは、真菌、特にかび、木材を変色させるおよび木材を分解する真菌(担子菌類)に対して、そして粘液生物および藻類に対して作用する。例としては下記の属の微生物などがある。すなわちアルタナリア・テヌイス(Alternaria tenuis)などのアルタナリア(Alternaria);アスペルギルス・ニガー(Aspergillus niger)などのアスペルギルス(Aspergillus);ケトミウム・グロボーサム(Chaetomium globosum)などのケトミウム(Chaetomium);コニオホーラ・プエタナ(Coniophora puetana)などのコニオホーラ(Coniophora);レンティナス・チグリヌス(Lentinus tigrinus)などの

10

20

30

40

50

レンティナス (*Lentinus*) ; ペニシリウム・グラウカム (*Penicillium glaucum*) などのペニシリウム (*Penicillium*) ; ポリポルス・バージカラー (*Polyporus versicolor*) などのポリポルス (*Polyporus*) ; アウレオバシジウム・プルランス (*Aureobasidium pullulans*) などのアウレオバシジウム (*Aureobasidium*) ; スクレロフォォーマ・ピティオフィラ (*Sclerophoma pityophila*) などのスクレロフォォーマ (*Sclerophoma*) ; トリコデルマ・ヴィリデ (*Trichoderma viride*) などのトリコデルマ (*Trichoderma*) ; 大腸菌などのエシェリキア属 (*Escherichia*) ; 緑膿菌などのシュードモナス属 (*Pseudomonas*) ; 黄色ブドウ球菌などのブドウ球菌 (*Staphylococcus*) である。 10

【0238】

さらに、本発明による活性化合物は、非常に良好な抗カビ活性も有する。その化合物は、特に皮膚糸状菌および酵母、カビおよび二相性真菌 (例えば、カンジダ・アルビカンス (*Candida albicans*)、カンジダ・グラブラタ (*Candida glabrata*) などのカンジダ種) およびエピデルモフィトン・フロッコズム (*Epidermophyton floccosum*)、アスペルギルス・ニガー (*Aspergillus niger*) およびアスペルギルス・フミガタス (*Aspergillus fumigatus*) などのアスペルギルス (*Aspergillus*) 種、トリコフィトン・メンタグロフィテス (*Trichophyton mentagrophytes*) などのトリコフィトン (*Trichophyton*) 種、マイクロスポロン・カニス (*Microsporon canis*) およびオドイニイ (*oudouinii*) などの小孢子菌属 (*Microsporon*) 種において非常に広い抗カビ活性スペクトルを有する。この真菌の列記は、網羅される真菌スペクトルを全く限定することなく、説明のみを意図したものである。 20

【0239】

従って本発明による活性化合物は、医薬分野および非医薬分野の両方で用いることができる。

【0240】

本発明の活性化合物を殺菌剤として用いる場合、施用量は、施用の種類に応じて比較的広い範囲内で変動し得るものである。本発明による活性化合物の施用量は、 30

・植物部分、例えば葉の処理の場合、0.1から10000g/ha、好ましくは10から1000g/ha、特に好ましくは50から300g/ha (施用を灌水または滴下によって行う場合、特に岩綿または真珠岩などの不活性物質を用いる場合に施用量を減らすことも可能である。) ;

・種子処理の場合、2から200g/種子100kg、好ましくは3から150g/種子100kg、より好ましくは2.5から25g/種子100kg、さらにより好ましくは2.5から12.5g/種子100kg ;

・土壌処理の場合、0.1から10000g/ha、好ましくは1から5000g/haである。 40

【0241】

これらの施用量は、例示としてのみ挙げたものであって、本発明の意味において限定的ではない。

【0242】

従って本発明による活性化合物または組成物は、処理してから一定期間にわたり、言及した病原体による攻撃から植物を保護するのに用いることができる。保護を提供する期間は、通常は活性化合物で植物を処理してから1から28日間、好ましくは1から14日間、特に好ましくは1から10日間、非常に特に好ましくは1から7日間、または種子処理から200日以内にわたる。

【0243】

さらに、本発明による処理によって、収穫物および食品およびそれから製造される飼料中のマイコトキシン含有量を減らすことが可能である。次のマイコトキシン類を特に挙げるができるが、これらに限定されるものではない。すなわち次の真菌：フザリウム・アクミナム (*Fusarium acuminatum*)、フザリウム・アベナセウム (*F. avenaceum*)、フザリウム・クロオクウェレンセ (*F. crookwellense*)、フザリウム・クルモルム (*F. culmorum*)、フザリウム・グラミネアルム (*F. graminearum*) (ジベレラ・ゼアエ (*Gibberella zeae*))、フザリウム・エキセチ (*F. equiseti*)、フザリウム・フジコロイ (*F. fujikoroii*)、フザリウム・ムサルム (*F. musarum*)、フザリウム・オキシスポルム (*F. oxysporum*)、フザリウム・プロリフェラツム (*F. proliferatum*)、フザリウム・ポアエ (*F. poae*)、フザリウム・シュードグラミネアルム (*F. pseudograminearum*)、フザリウム・サムブシナム (*F. sambucinum*)、フザリウム・シルピ (*F. scirpi*)、フザリウム・セミテクトム (*F. semitectum*)、フザリウム・ソラニ (*F. solani*)、フザリウム・スポロトリコイデス (*F. sporotrichoides*)、フザリウム・ラングセチアエ (*F. langsethiae*)、フザリウム・セブグルチナンス (*F. subglutinans*)、フザリウム・トリシンクツム (*F. tricinctum*)、フザリウム・ベルチシリオイデス (*F. verticillioides*) などのフザリウム (*Fusarium*) 種などによって、さらに特ににはアスペルギルス (*Aspergillus*) 種、ペニシリウム (*Penicillium*) 種、クラビセプス・プルブレア (*Claviceps purpurea*)、スタキボトリス (*Stachybotrys*) 種によって産生されるデオキシニパレノール (DON)、ニパレノール、15-Ac-DON、3-Ac-DON、T2 - および HT2 - 毒素、フモニシン類、ゼアラレノン、モニリホルニン、フザリン、ジアセトキシシルペノール (DAS)、ボーベリシン、エンニアチン、フザロプロリフェリン、フザレノール、オクラトキシン類、パツリン、麦角アルカロイド類およびアフラトキシン類である。

【0244】

適切な場合、本発明による化合物は、一定の濃度または施用量で、除草剤、薬害軽減剤、成長調節剤もしくは植物特性を改善する薬剤として、または殺微生物剤、例えば、殺真菌剤、抗真菌剤、殺細菌剤、殺ウイルス剤 (ウイルスに対する薬剤など) としてまたは MLO (マイコプラズマ様微生物) および RLO (リケッチア (*rickettsia*) 様微生物) に対する薬剤として使用することもできる。適切な場合、それらは、他の活性化化合物の合成における中間体または前駆体として用いることもできる。

【0245】

本発明による活性化化合物は、植物の代謝に介入することから、成長調節剤として使用することも可能である。

【0246】

植物成長調節剤は、植物に対して各種効果を有し得る。それらの化合物の効果は実質的に、植物の発達段階に基づく施用時点、ならびに植物もしくはその環境に施用される活性化化合物の量、ならびに施用の様式によって決まる。各場合で、成長調節剤作物に対して一定の所望の効果を有するものでなければならない。

【0247】

植物成長調節化合物は、例えば植物の栄養成長を阻害するのに用いることができる。そのような成長阻害は、観賞用庭園、公園およびスポーツ施設での、道路沿いでの、空港または果実栽培での草刈りの回数を減らすことが可能であることから、例えば草の場合に経済的利益のあるものである。道路沿いおよびパイプラインもしくは高架線近傍での、または全く一般的に強い植物成長が望ましくない区域での草本植物および木本植物の成長を阻害することも重要である。

【0248】

穀物の縦成長の阻害における成長調節剤の使用も重要である。このようにして、収穫前の植物の倒伏のリスクを低減または完全になくすることができる。さらに、穀物において、成長調節剤は、やはり倒伏に対抗する茎を強化することができる。茎の安定化および強化のための成長調節剤の施用によって、穀物の倒伏リスクなしに、より多い肥料施用量を用いて収量を高めることができる。

【0249】

多くの穀物植物で、栄養成長の阻害によって、より高密度の植え付けが可能となることから、土壌表層基準でより高い収量を達成することが可能である。このようにして得られる相対的に小さい植物の別の利点は、作物の栽培および収穫が容易になるという点である。

10

【0250】

栄養植物成長を阻害することによって、養分および同化産物が、植物の成長部分と比較して花および果実形成に対してより有用であるという点で、収量も高めることができる。

【0251】

非常に多くの場合、成長調節剤を用いて栄養成長を促進することもできる。これは、成長植物部分を収穫する場合には非常に有用である。しかしながら栄養成長を促進することで、より多くの同化産物が形成されて、結果的により多くの果実またはより大きい果実が得られるという点で生殖成長も促進され得る。

【0252】

場合により、栄養成長に検出可能な変化を生じることなく、植物の代謝を操作することで、収量増加を達成することができる。さらに、成長調節剤を用いて植物の組成を変えることができ、それによって収穫物の品質向上を達成することができる。そこで例えば、サトウダイコン、サトウキビ、パイナップル、さらに柑橘果実における糖分含有率を高めるか、大豆または穀物におけるタンパク質含有量を高めることができる。例えば、成長調節剤を用いて、収穫前もしくは収穫後に、所望の成分、例えばサトウダイコンまたはサトウキビにおける糖分の分解を抑制することもできる。さらに、二次植物成分の産生または除去に良好な影響を与えることも可能である。挙げることができる1例は、ゴムノキにおけるラテックスの流れの刺激である。

20

【0253】

成長調節剤の影響下に、単為結実果実を形成することができる。さらに、花の性別に影響を与えることが可能である。雑種種子の育種および生産において非常に重要である無菌花粉を製造することもできる。

30

【0254】

成長調節剤を用いることで、植物の枝分かれを制御することができる。一方、頂芽優性を破壊することで、成長抑制とも組み合わせ、特に観賞植物の栽培で非常に望ましい場合がある横芽の発達を促進することができる。しかしながら他方、横芽の成長を抑制することも可能である。この効果は、例えばタバコの栽培またはトマトの栽培において特に興味深いものである。

【0255】

成長調節剤の影響下に、植物における葉の量を制御して、植物の落葉を所望の時点で行うようにすることができる。そのような落葉は、綿の機械収穫で主要な役割を果たすが、他の作物、例えばブドウ栽培での収穫を容易にする上でも興味深いものである。植物の落葉は、移植する前に植物の蒸散を低下させるのに行うこともできる。

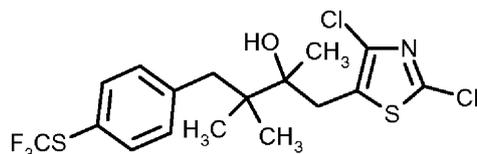
40

【0256】

成長調節剤はまた、果実の裂開を調節するのに用いることができる。一方で、早期の果実裂開を防止することができる。他方、果実の裂開または花の不結実を促進して、所望の量を得て（「間引き」）、交互性を破ることもできる。交互性とは、内因性の要因により、年ごとに収穫量が大きく変動するという一部の果実種の特徴と理解される。最後に、収穫の時点で成長調節剤を用いて、果実を切り離すのに要する力を低減することで、機械による収穫を可能としたり、手作業での収穫を楽にすることが可能である。

50

【化 8】



【0265】

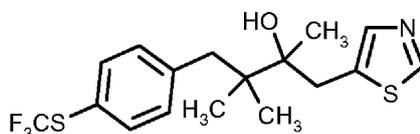
最初に 2, 4 - ジクロロチアゾール (1 . 7 5 g) をテトラヒドロフラン (T H F) (8 0 m L) に入れ、 n - ブチルリチウム (0 , 7 0 g) を - 7 8 で加えた。混合物を指定温度で 1 0 分間攪拌し、 2 - メチル - 2 - (2 - メチル - 1 - { 4 - [(トリフルオロメチル) スルファニル] フェニル } プロパン - 2 - イル) オキシラン (3 . 0 g) の T H F (1 0 m L) 中溶液を滴下した。冷却浴を外し、反応混合物を室温で終夜攪拌した。飽和塩化アンモニウム溶液を加え、水相を分離し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィー的に精製した。これによって、 1 - (2 , 4 - ジクロロ - 1 , 3 - チアゾール - 5 - イル) - 2 , 3 , 3 - トリメチル - 4 - { 4 - [(トリフルオロメチル) スルファニル] フェニル } ブタン - 2 - オール (1 . 3 0 g) を得た。

10

【0266】

段階 3

【化 9】



20

【0267】

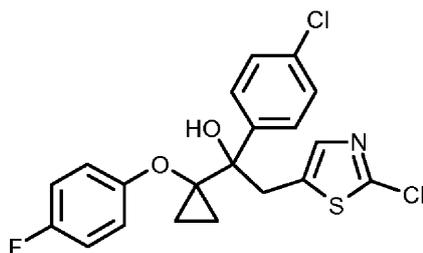
最初に、 1 - (2 , 4 - ジクロロ - 1 , 3 - チアゾール - 5 - イル) - 2 , 3 , 3 - トリメチル - 4 - { 4 - [(トリフルオロメチル) スルファニル] フェニル } ブタン - 2 - オール (0 . 5 0 g) およびラネーニッケル (1 . 0 g) をエタノールに入れた。混合物を最初に 1 2 0 および 1 M P a (1 0 パール) の水素雰囲気で 1 2 時間攪拌し、次に 1 0 0 および 1 M P a (1 0 パール) の水素雰囲気ですらに 3 時間攪拌した。混合物を濾過し、濾液を減圧下に濃縮し、残留物をクロマトグラフィー的に精製した。これによって、 2 , 3 , 3 - トリメチル - 1 - (1 , 3 - チアゾール - 5 - イル) - 4 - { 4 - [(トリフルオロメチル) スルファニル] フェニル } ブタン - 2 - オール (6 m g) を得た。

30

【0268】

化合物 2 および 3 の製造段階 1

【化 10】



40

【0269】

- 7 8 で、 2 - クロロチアゾール (2 . 0 g) の T H F (1 2 m L) 中溶液に n - ブチルリチウム (1 . 0 g) を滴下した。 3 0 分後、 2 - (4 - クロロフェニル) - 2 - [1 - (4 - フルオロフェノキシ) シクロプロピル] オキシラン (4 . 5 g) の T H F (3

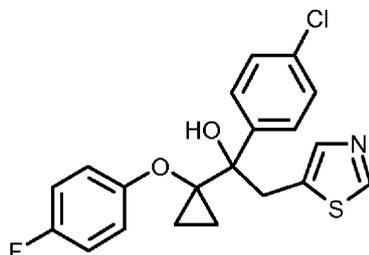
50

mL) 中溶液を加えた。混合物を終夜で昇温させて室温とした。水を加え、水相を分離し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィー的に精製した。これによって、1-(4-クロロフェニル)-2-(2-クロロ-1,3-チアゾール-5-イル)-1-[1-(4-フルオロフェノキシ)シクロプロピル]エタノール(化合物3)(1.00g)を得た。

【0270】

段階2

【化11】



10

【0271】

最初に、1-(4-クロロフェニル)-2-(2-クロロ-1,3-チアゾール-5-イル)-1-[1-(4-フルオロフェノキシ)シクロプロピル]エタノール(0.60g)を氷酢酸に入れた。垂鉛末を加え、混合物を8時間加熱還流した。水酸化アンモニウム水溶液を加えた。水相を分離し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィー的に精製した。これによって、1-(4-クロロフェニル)-1-[1-(4-フルオロフェノキシ)シクロプロピル]-2-(1,3-チアゾール-5-イル)エタノール(化合物2)(0.33g)を得た。

20

【0272】

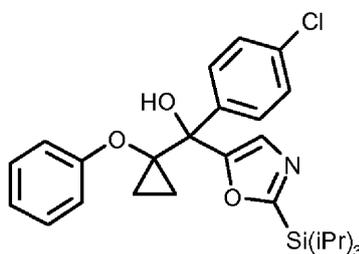
同様にして、化合物10を得た。

【0273】

化合物8および9の製造

段階1

【化12】



30

【0274】

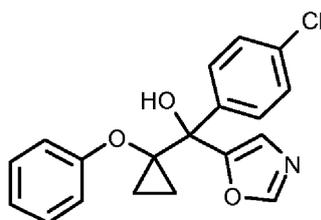
-25で、2-(トリイソプロピルシリル)-1,3-オキサゾール(2.25g)のテトラヒドロフラン(30mL)中溶液にn-ブチルリチウムを滴下した。15分後、(4-クロロフェニル)(1-フェノキシシクロプロピル)メタノールのTHF(3mL)中溶液を滴下し、混合物を-25から20の温度で撹拌した。水を加え、水相を分離し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィー的に精製した。これによって、(4-クロロフェニル)(1-フェノキシシクロプロピル)[2-(トリイソプロピルシリル)-1,3-オキサゾール-5-イル]メタノール(化合物9)(2.62g)を得た。

40

【0275】

段階2

【化 1 3】



【0 2 7 6】

最初に、(4-クロロフェニル)(1-フェノキシシクロプロピル)[2-(トリイソプロピルシリル)-1,3-オキサゾール-5-イル]メタノール(1.50 g)をTHFに入れた。塩酸(1N、5 mL)を滴下した。水を加え、水相を分離し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィー的に精製した。これによって、(4-クロロフェニル)(1,3-オキサゾール-5-イル)(1-フェノキシシクロプロピル)メタノール(化合物8)(0.84 g)を得た。

10

【0 2 7 7】

同様にして、化合物4、5、6および7を得た。

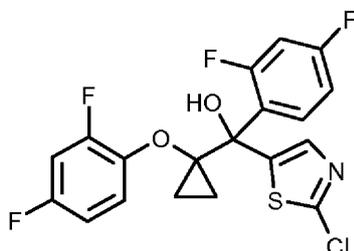
【0 2 7 8】

化合物 11 および 12 の製造

20

段階 1

【化 1 4】



30

【0 2 7 9】

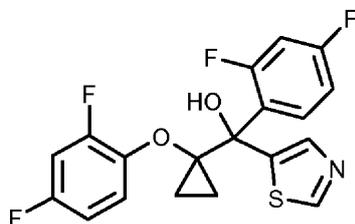
-25 で、n-ブチルリチウムを2-クロロチアゾール(1.20 g)のTHF(30 mL)中溶液に滴下した。15分後、[1-(2,4-ジフルオロフェノキシ)シクロプロピル](2,4-ジフルオロフェニル)メタノールのTHF(3 mL)中溶液を滴下し、混合物を、-25 から20 の温度で終夜撹拌した。水を加え、水相を分離し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィー的に精製した。これによって、(2-クロロ-1,3-チアゾール-5-イル)[1-(2,4-ジフルオロフェノキシ)シクロプロピル](2,4-ジフルオロフェニル)メタノール(実施例12)(0.47 g)を得た。

40

【0 2 8 0】

段階 2

【化 1 5】



50

【0 2 8 1】

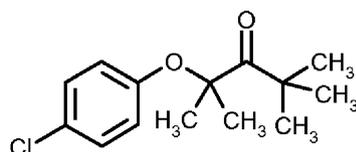
最初に、(2-クロロ-1,3-チアゾール-5-イル)[1-(2,4-ジフルオロフェノキシ)シクロプロピル](2,4-ジフルオロフェニル)メタノール(0.43g)を氷酢酸に入れた。亜鉛末(0.20g)を加え、混合物を3時間還流加熱した。水酸化アンモニウム水溶液を加えた。水相を分離し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィー的に精製した。これによって、[1-(2,4-ジフルオロフェノキシ)シクロプロピル](2,4-ジフルオロフェニル)1,3-チアゾール-5-イルメタノール(0.17g)を得た。

【0282】

化合物16の製造

段階1

【化16】



10

【0283】

4-クロロフェノール(1.00g)および炭酸カリウム(2.15g)を、2-ブromo-2,4,4-トリメチルペンタン-3-オン(3.22g)のDMSO(5mL)中溶液に加え、混合物を140で撹拌した。水を反応混合物に加え、水相を分離した。水相を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィー的に精製した。これによって、2-(4-クロロフェノキシ)-2,4,4-トリメチルペンタン-3-オン(560mg、27%)を得た。

20

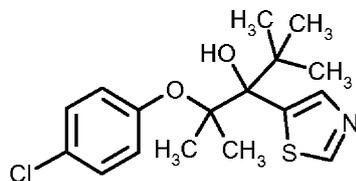
【0284】

¹H NMR (DMSO-d₆): (ppm): 1.27 (s, 9H)、1.43 (s, 6H)、6.98 (d, 2H)、7.37 (d, 2H)。

【0285】

段階2

【化17】



30

【0286】

-78で、1.6M n-ブチルリチウム/THF溶液(0.63mL)をゆっくり2-(トリメチルシリル)-1,3-チアゾール(157mg)のジエチルエーテル(4mL)中溶液に滴下した。反応混合物を-78で30分間撹拌し、少量のジエチルエーテルに溶かした2-(4-クロロフェノキシ)-2,4,4-トリメチルペンタン-3-オン(255mg)を滴下した。反応混合物を-78で撹拌し、ゆっくり昇温させて室温とした。室温で、飽和塩化アンモニウム溶液を直ちに反応混合物に加え、水相を分離した。水相をジクロロメタンで抽出し、合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィー的に精製した。これによって、2-(4-クロロフェノキシ)-2,4,4-トリメチル-3-(1,3-チアゾール-5-イル)ペンタン-3-オール(162mg、48%)を得た。

40

【0287】

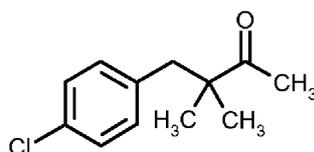
同様に、化合物13、14および15を得た。

【0288】

50

化合物 2 2 の製造段階 1

【化 1 8】



【0 2 8 9】

20 で、1 - クロロ - 4 - (クロロメチル) ベンゼン (3.00 g) および 3 - メチ
ルブタン - 2 - オン (2.41 g) の混合物を水酸化カリウム (3.14 g) およびヨウ
化テトラ - n - ブチルアンモニウム (2.06 g) の懸濁液に加えた。反応混合物を室温
で終夜撹拌した。水を反応混合物に加え、水相を分離した。水相を酢酸エチルで抽出し、
合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフ
ィー的に精製した。これによって、4 - (4 - クロロフェニル) - 3, 3 - ジメチルブタ
ン - 2 - オン (1.10 g、28%) を得た。

10

【0 2 9 0】

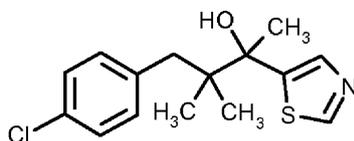
^1H NMR (DMSO - d_6) : (ppm) : 1.02 (s、6H)、2.14 (s、3H)、2.78 (s、2H)、7.12 (d、2H)、7.32 (d、2H)。

【0 2 9 1】

20

段階 2

【化 1 9】



【0 2 9 2】

- 78 で、1.6 M n - ブチルリチウム / THF 溶液 (0.80 mL) を、ゆっく
り 2 - (トリメチルシリル) - 1, 3 - チアゾール (200 mg) のジエチルエーテル (5 mL) 中溶液に滴下した。反応混合物を - 78 で 10 分間撹拌し、ジエチルエーテル (2 mL) に溶かした 4 - (4 - クロロフェニル) - 3, 3 - ジメチルブタン - 2 - オン (297 mg) を滴下した。反応混合物を - 78 で撹拌し、ゆっくり昇温させて室温とした。室温で、飽和塩化アンモニウム溶液を直ちに反応混合物に加え、水相を分離した。水相をジクロロメタンで抽出し、合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィー的に精製した。これによって、4 - (4 - クロロフェニル) - 3, 3 - ジメチル - 2 - (1, 3 - チアゾール - 5 - イル) ブタン - 2 - オール (390 mg、100%) を得た。

30

【0 2 9 3】

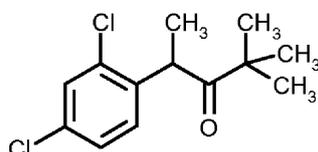
同様にして、化合物 17、18、19、20 および 21 を得た。

40

【0 2 9 4】

化合物 2 3 の製造段階 1

【化 2 0】



【0 2 9 5】

50

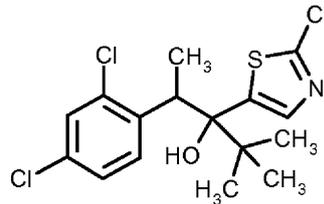
ナトリウムエトキシド (4.38 mL) をメチル硫酸トリメチルスルホニウム (1.31 g) のアセトニトリル (50 mL) 中溶液に加えた。反応混合物を30分間攪拌し、アセトニトリルに溶かした1-(2,4-ジクロロフェニル)-3,3-ジメチルブタン-2-オン (1.07 g) を滴下した。反応混合物を終夜攪拌し、水を加え、水相を分離した。水相を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機相を硫酸マグネシウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィー的に精製した。これによって、4-(2,4-ジクロロフェニル)-2,2-ジメチルペンタン-3-オン (750 mg、51%) を得た。

【0296】

段階2

【化21】

10



【0297】

-78 およびアルゴン下に、1.6 M n-ブチルリチウム / THF 溶液 (1.68 mL) を2-クロロ-1,3-チアゾール (526 mg) のTHF (25 mL) 中溶液に滴下した。反応混合物を-78 で30分間攪拌し、THFに溶かした4-(2,4-ジクロロフェニル)-2,2-ジメチルペンタン-3-オン (1.04 g) を滴下した。反応混合物を-78 で攪拌し、ゆっくり昇温させて室温とした。反応混合物を終夜攪拌し、水を加え、水相を分離した。水相を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機相を硫酸マグネシウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィー的に精製した。これによって、3-(2-クロロ-1,3-チアゾール-5-イル)-4-(2,4-ジクロロフェニル)-2,2-ジメチルペンタン-3-オール (化合物24) (750 mg、49%) を得た。

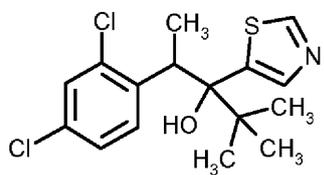
20

【0298】

段階3

【化22】

30



【0299】

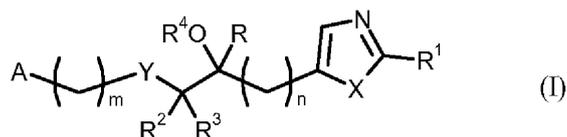
3-(2-クロロ-1,3-チアゾール-5-イル)-4-(2,4-ジクロロフェニル)-2,2-ジメチルペンタン-3-オール (500 mg) の酢酸 (20 mL) 中溶液を加熱還流した。亜鉛末 (259 mg) を加えた。反応混合物を2時間攪拌し、アンモニア水を加え、水相を分離した。水相を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機相を硫酸マグネシウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィー的に精製した。これによって、4-(4-クロロフェニル)-3,3-ジメチル-2-(1,3-チアゾール-5-イル)ブタン-2-オール (240 mg、52%) を得た。

40

【0300】

表1

【化 2 3】



【表 1】

R⁴=H

番号	X	Y	m	n	R	R ¹	R ²	R ³	A	LogP
1	S	結合	1	1	Me	H	Me	Me	4-SCF ₃ -フェニル	
2	S	O	0	1	ClPh	H	-CH ₂ CH ₂ -		FPh	3.62 ^[b] ;3.65 ^[c]
3	S	O	0	1	ClPh	Cl	-CH ₂ CH ₂ -		FPh	4.55 ^[b] ;4.53 ^[c]
4	O	O	0	0	DFPh	H	-CH ₂ CH ₂ -		DFPh	3.07 ^[b] ;3.1 ^[c]
5	O	O	0	0	BrPh	H	-CH ₂ CH ₂ -		フェニル	3.51 ^[b] ;3.48 ^[c]
6	O	O	0	0	BrPh	H	-CH ₂ CH ₂ -		DFPh	3.59 ^[b] ;3.56 ^[c]
7	O	O	0	0	BrPh	H	-CH ₂ CH ₂ -		FPh	3.54 ^[b] ;3.52 ^[c]
8	O	O	0	0	ClPh	H	-CH ₂ CH ₂ -		フェニル	3.37 ^[b] ;3.43 ^[c]
9	O	O	0	0	ClPh	Si(iPr) ₃	-CH ₂ CH ₂ -		フェニル	7.36 ^[b] ;7.36 ^[c]
10	S	O	0	1	BrPh	Cl	-CH ₂ CH ₂ -		DFPh	4.69 ^[b] ;4.6 ^[c]
11	S	O	0	0	DFPh	H	-CH ₂ CH ₂ -		DFPh	3.35 ^[b] ;3.3 ^[c]
12	S	O	0	0	DFPh	Cl	-CH ₂ CH ₂ -		DFPh	4.29 ^[b] ;4.23 ^[c]
13	S	O	0	0	t-Bu	H	Me	Me	4-OMe-フェニル	3.49 ^[b]
14	S	O	0	0	t-Bu	H	Me	Me	2-F-4-I-フェニル	4.7 ^[b]
15	S	O	0	0	t-Bu	H	Me	Me	BrPh	4.27 ^[b]
16	S	O	0	0	t-Bu	H	Me	Me	ClPh	4.13 ^[b]
17	S	結合	1	0	Me	H	Me	Me	4-OCF ₃ -フェニル	
18	S	結合	1	0	Me	H	Me	Me	BrPh	3.22 ^[b]
19	S	結合	1	0	Me	H	Me	Me	2-Cl-4-F-フェニル	3.14 ^[b]
20	S	結合	1	0	Me	H	Me	Me	IPh	3.45 ^[b]
21	S	結合	1	0	Me	H	Me	Me	4-CF ₃ -フェニル	3.34 ^[b]
22	S	結合	1	0	Me	H	Me	Me	ClPh	3.11 ^[b]
23	S	結合	0	0	t-Bu	H	Me	H	DCIPh	4.4 ^[a]
24	S	結合	0	0	t-Bu	Cl	Me	H	DCIPh	
25	S	結合	0	0	Dfmp	H	Me	H	2-Cl-4-F-フェニル	3.46 ^[b]
26	S	結合	0	0	Dfmp	Cl	Me	H	2-Cl-4-F-フェニル	4.51 ^[a]

FPh=4-フルオロフェニル;ClPh=4-クロロフェニル;BrPh=4-ブromフェニル;IPh=4-イソプロピルフェニル;DFPh=2,4-ジフルオロフェニル;ClPh=2,4-ジクロロフェニル;Si(iPr)₃=トリイソプロピルシリル;t-Bu=tert-ブチル;Me=メチル;OMe=メトキシ;CF₃=トリフルオロメチル;OCF₃=トリフルオロメトキシ;SCF₃=トリフルオロメチルチオ;Dfmp=1,3-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル

10

20

30

40

50

【 0 3 0 1 】

log P 値は、下記の方法を用い、逆相カラム (C 1 8) を用いる H P L C (高速液体クロマトグラフィー) によって、E E C 通達 7 9 / 8 3 1 補遺 V . A 8 に従って測定した。

【 0 3 0 2 】

[a] 酸性範囲での測定は、移動相 0 . 1 % リン酸水溶液およびアセトニトリル ; 1 0 % アセトニトリルから 9 5 % アセトニトリルの直線勾配を用いて p H 2 . 3 で行った。

【 0 3 0 3 】

[b] 酸性範囲での L C - M S 測定は、移動相 0 . 1 % ギ酸水溶液およびアセトニトリル (0 . 1 % ギ酸を含む) ; 1 0 % アセトニトリルから 9 5 % アセトニトリルの直線勾配を用いて p H 2 . 7 で行う。

10

【 0 3 0 4 】

[c] 中性範囲での L C - M S 測定は、移動相 0 . 0 0 1 M 重炭酸アンモニウム水溶液およびアセトニトリル ; 1 0 % アセトニトリルから 9 5 % アセトニトリルの直線勾配を用いて p H 7 . 8 で行う。

【 0 3 0 5 】

較正は、log P 値が既知である未分岐アルカン - 2 - オン類 (炭素原子数 3 から 1 6) を用いて行う (二つの連続するアルカノン間の直線内挿を用いる保持時間によって log P 値を測定する。) 。 2 0 0 n m から 4 0 0 n m の U V スペクトラムを用いるクロマトグラフィーシグナルの最大値で、 $m_{a x}$ 値を求めた。

20

【 0 3 0 6 】

選択された例の ^1H - N M R データは、 ^1H - N M R ピークリストの形で示している。各シグナルピークについて、最初に p p m 単位での 値および次に小括弧内のシグナル強度を列記している。異なるシグナルピークの シグナル強度値のペアを、セミコロンによって互いに分離して列記している。従って、一つの例についてのピークリストは、 ${}_1$ (強度 ${}_1$) ; ${}_2$ (強度 ${}_2$) ; . . . ; ${}_i$ (強度 ${}_i$) ; . . . ${}_n$ (強度 ${}_n$) の形態を取る。

【 0 3 0 7 】

化合物 1、溶媒 : C D C l ₃、スペクトル装置 : 6 0 1 . 6 M H z

8.6501 (0.44); 7.5800 (4.46); 7.5666 (4.94); 7.2959 (0.37); 7.2616 (15.74); 7.2379 (5.48); 7.2243 (5.16); 7.1931 (0.40); 3.2349 (1.20); 3.2107 (1.60); 3.0918 (2.37); 3.0678 (1.77); 2.8330 (0.65); 2.8118 (3.67); 2.8041 (3.78); 2.7830 (0.68); 2.7777 (0.34); 1.2537 (0.49); 1.1360 (13.86); 1.0848 (0.33); 0.9603 (1.33); 0.9435 (1.64); 0.9358 (16.00); 0.9223 (15.99); -0.0002 (9.37)

30

【 0 3 0 8 】

化合物 2、溶媒 : D M S O、スペクトル装置 : 3 9 9 . 9 5 M H z

8.7249 (2.39); 7.5832 (2.32); 7.4986 (2.29); 7.4771 (2.86); 7.2734 (2.80); 7.2520 (2.33); 6.9780 (1.20); 6.9724 (0.50); 6.9559 (2.25); 6.9452 (0.37); 6.9396 (0.51); 6.9339 (1.41); 6.6827 (1.44); 6.6768 (0.62); 6.6712 (1.54); 6.6656 (0.91); 6.6599 (1.32); 6.6543 (0.62); 6.6485 (1.27); 5.6667 (3.32); 4.0374 (0.41); 4.0196 (0.41); 3.8695 (0.93); 3.8320 (1.08); 3.4693 (1.03); 3.4318 (0.86); 3.3298 (17.70); 2.5063 (19.52); 2.5020 (25.50); 2.4977 (19.52); 1.9890 (1.73); 1.3971 (16.00); 1.2781 (0.40); 1.2671 (0.50); 1.2495 (0.76); 1.2360 (0.56); 1.1923 (0.47); 1.1745 (0.91); 1.1567 (0.47); 1.1432 (0.32); 1.1261 (0.51); 1.1161 (0.36); 1.1111 (0.47); 1.0988 (0.37); 0.7504 (0.35); 0.7395 (0.51); 0.7221 (0.50); 0.7081 (0.34); 0.6377 (0.36); 0.6218 (0.56); 0.6069 (0.48); 0.5935 (0.38); -0.0002 (5.63); -0.0081 (0.37)

40

【 0 3 0 9 】

化合物 3、溶媒 : D M S O、スペクトル装置 : 3 9 9 . 9 5 M H z

50

9.3473 (0.35); 7.5121 (1.30); 7.5074 (0.49); 7.4953 (0.51); 7.4905 (1.60); 7.3807 (1.35); 7.2989 (1.66); 7.2942 (0.53); 7.2820 (0.45); 7.2774 (1.37); 6.9809 (0.75); 6.9746 (0.48); 6.9636 (0.35); 6.9586 (1.25); 6.9532 (0.39); 6.9369 (0.84); 6.6752 (0.85); 6.6638 (0.89); 6.6580 (0.47); 6.6523 (0.75); 6.6409 (0.71); 5.8325 (1.99); 3.8805 (0.50); 3.8424 (0.56); 3.4172 (0.47); 3.3791 (0.40); 3.3343 (6.57); 2.5124 (2.48); 2.5080 (4.95); 2.5035 (6.51); 2.4989 (4.76); 2.4944 (2.37); 1.9898 (0.52); 1.3968 (16.00); -0.0002 (3.76)

【 0 3 1 0 】

化合物 4、溶媒：DMSO、スペクトル装置：399.95MHz

8.2880 (11.90); 7.7982 (1.31); 7.7811 (1.69); 7.7761 (2.76); 7.7591 (2.76); 7.7540 (1.72); 7.7369 (1.33); 7.2262 (13.23); 7.1480 (1.43); 7.1407 (2.56); 7.1330 (2.07); 7.1274 (2.65); 7.1190 (3.16); 7.1117 (3.23); 7.1048 (2.89); 7.1006 (1.61); 7.0901 (1.67); 7.0826 (1.57); 7.0492 (1.59); 7.0427 (1.39); 7.0259 (1.85); 7.0198 (2.80); 7.0135 (1.55); 6.9968 (1.59); 6.9903 (1.31); 6.7740 (0.77); 6.7711 (0.71); 6.7664 (0.74); 6.7508 (2.12); 6.7477 (2.11); 6.7434 (2.09); 6.7242 (3.15); 6.7102 (2.29); 6.7023 (2.58); 6.6879 (2.39); 6.6792 (1.11); 6.6649 (0.93); 6.6297 (16.00); 3.4349 (0.35); 3.4235 (0.40); 3.3154 (728.23); 3.2919 (6.94); 2.6744 (0.33); 2.6699 (0.41); 2.6652 (0.33);

10

【 0 3 1 1 】

2.5400 (0.67); 2.5097 (23.93); 2.5054 (43.96); 2.5009 (56.88); 2.4965 (39.24); 2.4921 (18.76); 2.3276 (0.36); 2.0692 (2.11); 1.3982 (1.21); 1.3681 (0.86); 1.3511 (1.38); 1.3416 (1.62); 1.3379 (1.47); 1.3272 (1.60); 1.3240 (1.69); 1.3096 (1.26); 1.1989 (1.13); 1.1816 (1.76); 1.1671 (1.76); 1.1574 (1.31); 1.1542 (1.31); 1.1405 (0.98); 1.0150 (0.93); 0.9971 (1.10); 0.9868 (1.95); 0.9723 (1.91); 0.9688 (2.01); 0.9553 (1.57); 0.9325 (1.72); 0.9188 (1.98); 0.9016 (1.67); 0.8908 (1.13); 0.8732 (0.68); -0.0002 (1.51)

20

【 0 3 1 2 】

化合物 5、溶媒：DMSO、スペクトル装置：399.95MHz

8.2949 (12.05); 8.2862 (0.51); 7.5062 (1.19); 7.4999 (8.26); 7.4951 (2.95); 7.4832 (3.74); 7.4783 (12.75); 7.4721 (1.88); 7.4060 (2.12); 7.4000 (12.86); 7.3950 (3.76); 7.3831 (3.14); 7.3783 (8.32); 7.3720 (1.10); 7.2429 (0.69); 7.2350 (13.51); 7.0678 (0.77); 7.0622 (4.33); 7.0571 (1.75); 7.0437 (6.67); 7.0408 (6.41); 7.0269 (2.23); 7.0223 (5.45); 7.0164 (0.94); 6.8274 (2.60); 6.8092 (4.31); 6.7908 (1.91); 6.5309 (6.18); 6.5283 (7.65); 6.5090 (6.99); 6.4760 (16.00); 3.3146 (341.18); 3.2913 (2.35); 2.5092 (13.03); 2.5049 (24.14); 2.5004 (31.32); 2.4961 (21.67); 2.4917 (10.33); 1.9867 (0.34); 1.2971 (0.73); 1.2842 (0.90); 1.2799 (1.00); 1.2697 (2.05); 1.2570 (1.91); 1.2527 (2.12); 1.2417 (2.09); 1.2306 (1.99); 1.2187 (2.08); 1.2153 (2.15); 1.2018 (2.01); 1.1921 (1.00); 1.1880 (1.02); 1.1748 (1.06); 0.9471 (1.03); 0.9344 (1.22); 0.9300 (1.20); 0.9176 (2.44); 0.9065 (1.71); 0.9020 (1.70); 0.8912 (1.26); 0.7987 (1.37); 0.7868 (1.76); 0.7834 (1.75); 0.7720 (2.30); 0.7591 (1.25); 0.7555 (1.24); 0.7420 (0.85); -0.0002 (0.49)

30

40

【 0 3 1 3 】

化合物 6、溶媒：DMSO、スペクトル装置：399.95MHz

8.3241 (12.65); 7.5350 (1.25); 7.5286 (9.04); 7.5238 (3.19); 7.5118 (3.85); 7.5069 (12.80); 7.5006 (1.81); 7.4112 (2.04); 7.4050 (12.80); 7.4000 (3.84); 7.3880 (3.33); 7.3833 (9.02); 7.3769 (1.16); 7.2362 (0.71); 7.2278 (13.98); 7.1543 (1.62); 7.1467 (1.66); 7.1323 (1.82); 7.1255 (2.84); 7.1185 (1.81); 7.1041 (1.71); 7.0965 (1.62); 6.7813 (0.86); 6.7771 (0.91); 6.7737 (0.89); 6.7697 (0.82); 6.7578 (1.92); 6.7538 (2.10); 6.7505 (1.91); 6.7376 (1.38); 6.7335 (1.47); 6.7299 (1.30); 6.7261 (1.19); 6.6860 (1.89); 6.6717 (2.07); 6.6626 (3.02); 6.6484 (2.90); 6.6394 (1.39); 6.6251 (1.26); 6.5926 (16.00); 6.4709 (0.33); 3.3249 (790.13); 3.3033 (4.94); 3.2685 (0.55); 3.2626 (0.44); 2.6706 (0.35); 2.5407 (0.45); 2.5105 (19.71); 2.5062 (36.85); 2.5017 (48.11); 2.4973 (33.36); 2.4930 (15.97); 1.9871 (0.60); 1.3980 (0.64); 1.2322 (0.68); 1.2161 (0.75); 1.2050 (1.90); 1.1927 (2.68); 1.1882 (3.45); 1.1835 (5.43); 1.1755 (3.36); 1.1613 (2.04); 1.1469 (0.77); 1.1341 (0.79); 0.9707 (1.05); 0.9588 (1.32); 0.9552 (1.24); 0.9431 (1.07); 0.9361 (1.61); 0.9305 (1.93); 0.9269 (1.99); 0.9224 (1.44); 0.8568 (0.33); 0.8288 (1.43); 0.8225 (2.01); 0.8134 (1.54); 0.8079 (1.33); 0.7920 (1.29); 0.7788 (0.83)

10

【 0 3 1 4 】

化合物 7、溶媒：DMSO、スペクトル装置：399.95MHz

8.3062 (11.44); 8.2998 (1.12); 7.5204 (1.14); 7.5140 (8.33); 7.5092 (2.91); 7.4973 (3.58); 7.4923 (12.02); 7.4860 (1.68); 7.4355 (0.37); 7.4303 (0.35); 7.4154 (0.58); 7.4115 (0.60); 7.4009 (1.94); 7.3947 (12.07); 7.3897 (3.52); 7.3778 (3.10); 7.3730 (8.45); 7.3665 (1.04); 7.3034 (0.43); 7.2870 (0.58); 7.2846 (0.57); 7.2457 (0.97); 7.2309 (12.74); 6.9137 (0.47); 6.9038 (4.63); 6.8980 (1.61); 6.8925 (0.91); 6.8863 (2.31); 6.8815 (7.46); 6.8710 (1.02); 6.8656 (1.89); 6.8596 (5.30); 6.8498 (0.66); 6.8456 (0.59); 6.8233 (0.36); 6.5733 (0.62); 6.5634 (5.54); 6.5574 (2.14); 6.5519 (5.87); 6.5461 (3.13); 6.5404 (4.96); 6.5347 (2.03); 6.5289 (4.75); 6.5078 (16.00); 6.4921 (0.44); 6.4805 (0.37); 6.3773 (0.99); 5.7462 (0.87); 3.3819 (0.38); 3.3135 (423.06); 2.5398 (0.36); 2.5096 (15.67); 2.5053 (29.34); 2.5008 (38.41); 2.4964 (26.44); 2.4919 (12.59); 1.9869 (0.47); 1.3980 (0.55); 1.2575 (0.65); 1.2448 (0.82); 1.2405 (0.93); 1.2303 (1.94); 1.2178 (1.97); 1.2133 (2.19); 1.2036 (2.69); 1.1994 (2.74); 1.1886 (2.21); 1.1855 (2.17); 1.1720 (1.93); 1.1615 (0.80); 1.1578 (0.95); 1.1449 (0.79); 0.9798 (0.52); 0.9447 (1.12); 0.9321 (1.21); 0.9279 (1.23); 0.9143 (2.07); 0.9043 (1.65); 0.8999 (1.66); 0.8905 (1.22); 0.7921 (1.27); 0.7816 (1.69); 0.7783 (1.65); 0.7674 (2.24); 0.7538 (1.24); 0.7504 (1.21); 0.7370 (0.87); -0.0002 (0.89)

20

30

【 0 3 1 5 】

化合物 9、溶媒：DMSO、スペクトル装置：399.95MHz

9.3088 (0.91); 7.5288 (0.37); 7.5223 (2.45); 7.5175 (0.86); 7.5055 (1.04); 7.5006 (3.19); 7.4941 (0.44); 7.3665 (0.51); 7.3602 (3.23); 7.3553 (0.97); 7.3432 (0.90); 7.3386 (2.43); 7.2433 (4.64); 7.1748 (0.34); 7.1530 (0.46); 7.1351 (0.33); 7.0659 (1.18); 7.0610 (0.50); 7.0474 (1.84); 7.0446 (1.75); 7.0304 (0.61); 7.0260 (1.46); 6.8305 (0.70); 6.8122 (1.16); 6.7939 (0.52); 6.7609 (0.66); 6.7585 (0.67); 6.7393 (0.85); 6.5640 (1.70); 6.5615 (2.05); 6.5422 (1.88); 6.4180 (3.90); 3.3456 (120.27); 2.5123 (3.43); 2.5080 (6.34); 2.5035 (8.20); 2.4991 (5.66); 2.4948 (2.68); 1.3978 (5.43); 1.2864 (0.67); 1.2672 (1.50); 1.2613 (0.89); 1.2482 (2.41); 1.2300 (1.92); 1.2116 (1.00); 1.2034 (0.55); 1.1914 (0.66); 1.1875 (0.60); 1.1743 (0.56); 1.1601 (0.33); 1.1161 (0.51); 1.0963 (0.90); 1.0775 (0.92); 1.0460 (15.58); 1.0391 (16.00); 1.0274 (13.54); 1.0206 (12.95); 0.9965 (0.63); 0.9812 (0.99); 0.9013 (0.35); 0.8972 (0.33); 0.8863 (0.67); 0.8736 (0.52); 0.8692 (0.57); 0.8576 (0.40); 0.8091 (0.39); 0.7962 (0.50); 0.7932 (0.49); 0.7802 (0.52)

40

【 0 3 1 6 】

化合物 10、溶媒：DMSO、スペクトル装置：399.95MHz

50

8.6269 (0.32); 7.6199 (0.92); 7.5460 (0.38); 7.5430 (0.40); 7.5386 (0.38); 7.5248 (0.40); 7.4996 (0.34); 7.4799 (2.20); 7.4737 (1.30); 7.4576 (11.41); 7.4477 (11.52); 7.4314 (1.15); 7.4254 (2.09); 7.3978 (0.52); 7.3833 (6.20); 7.2126 (1.01); 7.2057 (1.02); 7.1904 (1.10); 7.1843 (1.95); 7.1772 (1.19); 7.1626 (1.09); 7.1552 (1.06); 6.8662 (0.49); 6.8586 (0.49); 6.8432 (1.42); 6.8405 (1.40); 6.8355 (1.43); 6.8207 (2.60); 6.8148 (1.66); 6.8059 (1.55); 6.7983 (1.67); 6.7838 (1.53); 6.7754 (0.68); 6.7609 (0.58); 5.8944 (8.45); 5.7574 (6.34); 3.8891 (2.31); 3.8510 (2.62); 3.4218 (2.26); 3.3844 (2.03); 3.3241 (33.33); 2.5249 (0.45); 2.5114 (7.74); 2.5071 (15.49); 2.5027 (20.41); 2.4982 (14.59); 2.4939 (7.01); 1.3970 (16.00); 1.3363 (0.44); 1.2490 (0.78); 1.2448 (0.75); 1.2309 (1.15); 1.2175 (1.11); 1.2009 (1.39); 1.1867 (0.96); 1.1340 (0.87); 1.1179 (1.41); 1.1020 (1.06); 1.0900 (0.90); 1.0746 (0.59); 0.7827 (0.58); 0.7672 (0.83); 0.7533 (1.13); 0.7372 (1.29); 0.7228 (0.84); 0.6724 (0.92); 0.6570 (1.46); 0.6418 (1.08); 0.6283 (0.91); 0.6122 (0.49); 0.0080 (0.41); -0.0002 (11.10); -0.0085 (0.44)

10

【 0 3 1 7 】

化合物 1 1、溶媒：DMSO、スペクトル装置：601.6MHz

9.0178 (3.49); 9.0169 (3.46); 7.9076 (0.36); 7.8961 (0.51); 7.8929 (0.78); 7.8816 (0.77); 7.8784 (0.50); 7.8669 (0.36); 7.7373 (3.64); 7.1792 (0.51); 7.1741 (0.54); 7.1692 (0.52); 7.1647 (1.01); 7.1601 (0.98); 7.1554 (1.28); 7.1509 (0.92); 7.1460 (0.63); 7.1409 (0.89); 7.1369 (0.52); 7.1127 (0.47); 7.1085 (0.42); 7.0974 (0.54); 7.0933 (0.81); 7.0892 (0.46); 7.0781 (0.46); 7.0738 (0.37); 6.7700 (0.33); 6.7565 (0.61); 6.7545 (0.65); 6.7522 (0.61); 6.7437 (0.35); 6.7410 (0.38); 6.7386 (0.35); 6.6939 (4.99); 6.5036 (0.39); 6.4942 (0.44); 6.4881 (0.75); 6.4787 (0.75); 6.4726 (0.40); 6.4632 (0.35); 5.7654 (16.00); 3.3511 (21.09); 2.5102 (5.05); 2.5074 (10.54); 2.5044 (14.29); 2.5014 (10.48); 2.4985 (4.96); 1.9913 (0.63); 1.3964 (0.80); 1.3536 (0.45); 1.3474 (0.52); 1.3436 (0.43); 1.3352 (0.60); 1.3254 (0.42); 1.2550 (0.42); 1.2449 (0.59); 1.2431 (0.63); 1.2368 (0.48); 1.2332 (0.63); 1.2268 (0.43); 1.2247 (0.50); 1.2149 (0.35); 1.1749 (0.34); 1.0073 (0.34); 0.9970 (0.46); 0.9955 (0.46); 0.9884 (0.62); 0.9857 (0.46); 0.9764 (0.64); 0.9666 (0.39); 0.8857 (0.44); 0.8757 (0.57); 0.8737 (0.57); 0.8668 (0.48); 0.8639 (0.55); 0.8571 (0.42); 0.8547 (0.46); -0.0002 (1.16)

20

30

【 0 3 1 8 】

化合物 1 4、溶媒：DMSO、スペクトル装置：399.95MHz

8.9266 (1.83); 7.8743 (2.75); 7.8729 (2.72); 7.6752 (0.99); 7.6699 (1.01); 7.6493 (1.00); 7.6440 (1.06); 7.4748 (0.59); 7.4719 (0.66); 7.4695 (0.60); 7.4669 (0.53); 7.4535 (0.65); 7.4505 (0.71); 7.4481 (0.66); 7.4455 (0.58); 6.9475 (0.70); 6.9259 (1.34); 6.9043 (0.68); 5.4599 (1.28); 3.3376 (53.33); 2.5096 (5.26); 2.5054 (7.21); 2.5020 (4.75); 1.4376 (2.72); 1.3966 (0.61); 1.1141 (0.65); 1.0947 (16.00); 1.0259 (2.46); -0.0002 (3.88)

【 0 3 1 9 】

化合物 1 5、溶媒：DMSO、スペクトル装置：399.95MHz

8.9268 (1.61); 7.8763 (2.36); 7.8749 (2.24); 7.4751 (2.43); 7.4698 (0.81); 7.4582 (0.86); 7.4529 (2.62); 7.0004 (0.33); 6.9919 (2.54); 6.9866 (0.85); 6.9750 (0.82); 6.9697 (2.31); 5.5666 (0.41); 5.4124 (1.13); 3.4322 (0.33); 3.3265 (389.05); 3.3033 (4.87); 2.5107 (9.61); 2.5065 (17.54); 2.5020 (22.59); 2.4976 (15.79); 2.4933 (7.76); 1.8195 (0.53); 1.8174 (0.52); 1.4772 (2.20); 1.3982 (0.47); 1.0887 (16.00); 1.0422 (0.33); 1.0053 (2.61); 0.9966 (3.81); -0.0002 (0.73)

40

【 0 3 2 0 】

化合物 1 6、溶媒：DMSO、スペクトル装置：399.95MHz

8.9274 (1.60); 7.8775 (2.35); 7.3483 (2.19); 7.3431 (0.80); 7.3314 (0.84); 7.3263 (2.50); 7.0434 (2.43); 7.0382 (0.84); 7.0265 (0.79); 7.0213 (2.11); 5.5652 (0.34); 5.4077 (1.12); 3.5172 (0.33); 3.4982 (0.37); 3.4911 (0.38); 3.4678 (0.46); 3.3172 (833.57); 2.6701 (0.49); 2.6661 (0.39); 2.5096 (29.45); 2.5055 (52.61); 2.5011 (66.80); 2.4968 (47.20); 2.3326 (0.35); 2.3280 (0.44); 2.3231 (0.32); 2.0690 (0.53); 1.8191 (0.59); 1.4748 (2.26); 1.3986 (0.47); 1.0906 (16.00); 1.0018 (2.82); 0.9964 (4.38); 0.9543 (0.60); -0.0002 (1.75)

【 0 3 2 1 】

化合物 1 7、溶媒：D M S O、スペクトル装置：3 9 9 . 9 5 M H z

8.9323 (6.47); 8.9310 (7.43); 7.7231 (6.23); 7.7217 (7.08); 7.2388 (1.94); 7.2169 (4.91); 7.1931 (7.63); 7.1874 (1.67); 7.1767 (1.08); 7.1711 (2.79); 5.7707 (6.04); 4.0578 (0.54); 4.0399 (1.66); 4.0222 (1.69); 4.0043 (0.56); 3.3486 (16.11); 3.3447 (15.71); 3.3421 (15.90); 3.3373 (24.88); 3.3348 (22.70); 3.3337 (23.80); 2.7263 (1.52); 2.6948 (2.29); 2.5845 (2.05); 2.5528 (1.38); 2.5091 (12.45); 2.5049 (16.96); 2.5014 (11.24); 1.9900 (7.43); 1.6102 (16.00); 1.1940 (2.04); 1.1762 (4.17); 1.1584 (2.01); 0.7577 (13.24); 0.7308 (12.85); 0.3287 (0.47); 0.1936 (0.53); 0.0143 (2.33); -0.0002 (8.55)

10

【 0 3 2 2 】

化合物 1 8、溶媒：D M S O、スペクトル装置：3 9 9 . 9 5 M H z

8.9259 (6.72); 8.9246 (6.59); 7.7144 (6.78); 7.7130 (6.72); 7.4625 (0.93); 7.4555 (1.00); 7.4401 (1.13); 7.4338 (6.07); 7.4294 (1.98); 7.4174 (1.95); 7.4129 (6.69); 7.4064 (0.72); 7.0678 (0.41); 7.0462 (0.47); 7.0336 (5.80); 7.0126 (5.24); 5.7463 (8.48); 4.7674 (1.07); 3.3218 (141.50); 3.2982 (1.50); 2.7577 (0.68); 2.6754 (0.36); 2.6706 (0.53); 2.6612 (1.65); 2.6294 (2.33); 2.5410 (0.35); 2.5240 (2.97); 2.5059 (43.77); 2.5018 (58.42); 2.3286 (0.40); 2.1361 (2.57); 1.9888 (0.42); 1.5988 (16.00); 1.5674 (0.47); 1.5259 (0.46); 1.3974 (2.49); 1.2903 (0.53); 1.2586 (0.39); 1.2349 (1.41); 1.0666 (0.48); 1.0178 (3.19); 0.8538 (0.38); 0.7783 (0.37); 0.7633 (0.53); 0.7435 (13.46); 0.7189 (13.06); 0.6883 (0.37); 0.0080 (0.71); -0.0002 (23.69); -0.0084 (0.76)

20

【 0 3 2 3 】

化合物 1 9、溶媒：D M S O、スペクトル装置：6 0 1 . 6 M H z

8.9394 (6.39); 7.7414 (6.77); 7.7409 (6.67); 7.3736 (2.01); 7.3691 (2.02); 7.3588 (2.09); 7.3543 (1.97); 7.2779 (1.52); 7.2672 (1.73); 7.2635 (2.00); 7.2528 (1.83); 7.1489 (1.18); 7.1443 (1.12); 7.1348 (2.03); 7.1303 (1.85); 7.1207 (1.01); 7.1162 (0.89); 5.8257 (7.69); 4.0462 (0.37); 4.0344 (1.12); 4.0226 (1.13); 4.0107 (0.38); 3.3553 (117.21); 3.3310 (0.40); 2.8894 (1.56); 2.8676 (2.11); 2.7571 (1.56); 2.7353 (1.16); 2.5256 (0.54); 2.5226 (0.74); 2.5194 (0.91); 2.5106 (12.96); 2.5077 (26.51); 2.5047 (35.60); 2.5017 (26.05); 2.4989 (12.36); 2.0794 (0.38); 1.9913 (4.91); 1.9104 (1.57); 1.6253 (16.00); 1.1867 (1.34); 1.1749 (2.63); 1.1630 (1.32); 1.1059 (0.66); 0.8045 (12.81); 0.7734 (11.79); -0.0002 (0.58)

30

【 0 3 2 4 】

化合物 2 0、溶媒：D M S O、スペクトル装置：3 9 9 . 9 5 M H z

8.9237 (7.25); 7.7112 (7.01); 7.7101 (6.70); 7.6048 (0.66); 7.5989 (5.98); 7.5784 (6.52); 6.8900 (5.58); 6.8694 (5.35); 5.7437 (7.72); 3.3389 (50.86); 3.3338 (89.54); 3.3103 (0.81); 2.6364 (1.55); 2.6051 (2.36); 2.5210 (0.44); 2.5118 (9.15); 2.5077 (17.85); 2.5034 (25.16); 2.4992 (19.46); 2.4670 (1.46); 1.5958 (16.00); 1.3970 (11.61); 0.7387 (13.65); 0.7141 (13.24); -0.0002 (4.34)

40

【 0 3 2 5 】

化合物 2 1、溶媒：D M S O、スペクトル装置：3 9 9 . 9 5 M H z

8.9405 (7.16); 7.7358 (6.87); 7.6124 (3.75); 7.5921 (4.31); 7.3098 (3.89); 7.2897 (3.52); 5.8114 (8.51); 5.7600 (1.48); 3.3436 (109.53); 3.3201 (0.74); 2.7885 (1.43); 2.7574 (2.14); 2.6478 (1.96); 2.6168 (1.31); 2.5093 (15.94); 2.5053 (21.28); 1.6206 (16.00); 0.7656 (13.51); 0.7377 (13.07); -0.0002 (6.58)

【 0 3 2 6 】

化合物 2 2、溶媒：DMSO、スペクトル装置：399.95MHz

8.9135 (6.58); 8.9125 (6.78); 7.7025 (6.42); 7.7013 (6.66); 7.3149 (0.38); 7.2983 (0.65); 7.2940 (1.12); 7.2880 (5.64); 7.2835 (2.02); 7.2775 (0.91); 7.2718 (2.04); 7.2671 (6.96); 7.2608 (0.84); 7.1135 (0.42); 7.0929 (0.39); 7.0852 (0.79); 7.0785 (5.98); 7.0575 (4.90); 7.0509 (0.56); 5.7357 (7.38); 5.2708 (3.67); 4.0255 (0.68); 4.0077 (0.65); 3.3211 (42.40); 3.3163 (64.85); 3.2932 (0.65); 2.7611 (0.64); 2.6661 (1.58); 2.6344 (2.36); 2.5288 (2.18); 2.4940 (22.46); 2.4898 (30.00); 2.4859 (20.62); 2.1234 (1.68); 1.9759 (2.90); 1.6059 (0.45); 1.5880 (16.00); 1.5568 (0.45); 1.1798 (0.79); 1.1619 (1.61); 1.1441 (0.77); 1.0062 (2.47); 0.8511 (0.36); 0.8378 (0.39); 0.8210 (0.36); 0.7890 (0.36); 0.7723 (0.42); 0.7669 (0.42); 0.7527 (0.68); 0.7328 (13.45); 0.7082 (12.97); 0.6751 (0.43); 0.0463 (0.52); 0.0081 (1.44); -0.0002 (50.98); -0.0086 (1.74); -0.0136 (6.65)

10

【 0 3 2 7 】

化合物 2 3、溶媒：DMSO、スペクトル装置：399.95MHz

8.9940 (1.03); 7.9160 (0.62); 7.8943 (0.67); 7.7929 (1.40); 7.5752 (1.80); 7.5695 (1.90); 7.3834 (0.88); 7.3777 (0.84); 7.3618 (0.82); 7.3561 (0.79); 5.7274 (1.92); 3.3593 (85.38); 2.5143 (3.56); 2.5098 (7.20); 2.5052 (9.62); 2.5006 (7.00); 2.4961 (3.43); 1.3973 (1.89); 0.9108 (2.52); 0.8934 (2.50); 0.7280 (16.00)

20

【 0 3 2 8 】

化合物 2 4、溶媒：DMSO、スペクトル装置：601.6MHz

7.8225 (0.34); 7.5837 (2.02); 7.5799 (2.10); 7.5651 (3.94); 7.3837 (0.93); 7.3800 (0.90); 7.3694 (0.89); 7.3656 (0.87); 5.9089 (0.60); 3.3467 (84.07); 3.3228 (0.71); 2.5216 (0.34); 2.5185 (0.34); 2.5097 (9.15); 2.5067 (20.26); 2.5036 (27.71); 2.5006 (19.68); 2.4976 (8.70); 1.3971 (7.83); 1.0552 (0.58); 0.9956 (1.77); 0.9841 (1.76); 0.7473 (16.00); -0.0002 (5.29)

30

【 0 3 2 9 】

化合物 2 5、溶媒：DMSO、スペクトル装置：399.95MHz

9.0932 (7.01); 7.9109 (11.37); 7.8613 (1.50); 7.8402 (1.95); 7.8228 (1.53); 7.4786 (4.03); 7.4717 (4.21); 7.4563 (4.16); 7.4495 (4.07); 7.2706 (1.85); 7.2637 (1.76); 7.2494 (2.91); 7.2425 (2.75); 7.2278 (1.82); 7.2208 (1.53); 6.1387 (11.26); 4.3408 (1.83); 4.3167 (2.18); 4.2869 (1.99); 4.2825 (1.82); 4.2714 (0.52); 4.2209 (3.50); 4.1962 (3.29); 4.1683 (1.87); 4.1640 (1.98); 4.1028 (1.85); 4.0801 (1.18); 4.0657 (0.34); 4.0479 (0.80); 4.0302 (0.84); 4.0125 (0.46); 4.0019 (1.28); 3.9781 (1.14); 3.8801 (1.26); 3.8590 (1.15); 3.8542 (1.13); 3.7833 (1.47); 3.7673 (1.49); 3.4812 (0.33); 3.4602 (0.60); 3.4447 (0.72); 3.4232 (1.78); 3.3851 (2512.38); 3.3362 (0.98); 3.3170 (0.61); 3.2997 (0.44); 3.2844 (0.33); 2.6883 (0.49); 2.6840 (0.69); 2.6790 (0.51); 2.5533 (0.32); 2.5369 (1.20); 2.5189 (81.18); 2.5147 (110.71); 2.5106 (76.78); 2.3457 (0.48); 2.3413 (0.66); 2.3366 (0.51); 1.9983 (3.06); 1.9715 (2.12); 1.4066 (2.09); 1.2448 (0.50); 1.2024 (0.85); 1.1846 (1.68); 1.1667 (0.90); 1.1158 (0.71); 1.0376 (0.56); 0.9348 (12.98); 0.9174 (12.85); 0.8986 (0.87); 0.8861 (8.91); 0.8799 (16.00); 0.8737 (9.07)

40

【 0 3 3 0 】

化合物 2 6、溶媒：DMSO、スペクトル装置：399.95MHz

7.7818 (0.73); 7.7615 (1.06); 7.7438 (0.77); 7.6756 (9.45); 7.4697 (2.15); 7.4628 (2.22); 7.4474 (2.22); 7.4406 (2.16); 7.2585 (1.08); 7.2516 (1.06); 7.2372 (1.75); 7.2303 (1.64); 7.2157 (1.03); 7.2088 (0.90); 6.2841 (4.56); 4.3890 (0.71); 4.3851 (0.69); 4.3645 (1.20); 4.3608 (1.27); 4.3534 (0.96); 4.3289 (0.97); 4.2900 (1.10); 4.2667 (1.37); 4.2465 (1.19); 4.2425 (1.28); 4.2331 (0.91); 4.2088 (0.98); 4.1704 (1.07); 4.1470 (0.70); 4.0317 (0.79); 4.0279 (0.78); 4.0078 (0.70); 4.0031 (0.70); 3.9136 (0.76); 3.9091 (0.79); 3.8894 (0.72); 3.8849 (0.72); 3.7477 (0.73); 3.7325 (0.73); 3.3546 (114.39); 3.3445 (163.66); 2.5128 (16.71); 2.5084 (33.15); 2.5038 (43.81); 2.4992 (31.76); 2.4947 (15.50); 2.0735 (16.00); 1.0181 (6.85); 1.0007 (6.73); 0.8653 (5.61); 0.8592 (9.55); 0.8532 (5.64); -0.0002 (2.64)

10

【0331】

鋭いシグナルの強度は、cm単位でのNMRスペクトラムの印刷例におけるシグナルの高さに相関し、シグナル強度の真の比率を示す。広いシグナルの場合、いくつかのピークまたはシグナルの中央とそのスペクトラムにおいて最も強いシグナルと比較した相対強度を示すことができる。¹H-NMRピークリストは、従来の¹H-NMR印刷と類似していることから、通常は、従来のNMR解釈でリストされた全てのピークである。さらに、従来の¹H-NMR印刷と同様に、それらは溶媒シグナル、やはり本発明の主題の一部を形成する標的化合物の立体異性体のシグナル、および/または不純物のピークを示すことができる。溶媒および/または水の範囲での化合物シグナルの報告において、本発明者らの¹H-NMRピークのリストは、溶媒の通常のピーク、例えばDMSO-d₆中のDMSOのピークおよび水のピークを示し、それは通常は、概して高強度を有する。標的化合物の立体異性体のピークおよび/または不純物のピークは通常、概して標的化合物のピークより低い強度を有する(例えば、純度>90%を有する)。そのような立体異性体および/または不純物は、特定の製造方法に代表的であることができる。従って、それらのピークは、「副生成物フィンガープリント」を参照して本発明者らの製造方法の再現性を確認する上で役立つ。公知の方法(MestreC、ACDシミュレーションで、さらに経験的に評価される期待値で)で標的化合物のピークを計算する専門家であれば、必要に応じて適宜に別の強度フィルターを用いる標的化合物のピークを分離することができる。この分離は、従来の¹H-NMR解釈での関連するピーク選択と同様であると考えられる。ピークリストの形態でのNMRデータ提供の詳細な説明が、刊行物「Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications」(Research Disclosure Database Number 564025, 2011, 16 March 2011または<http://www.rdelectronic.co.uk/rd/free/RD564025.pdf>参照)にある。

20

30

【0332】

使用例

実施例 A

スファエロテカ(Sphaerotheca)試験(キュウリ)/保護

溶媒: N, N-ジメチルホルムアミド 49重量部

乳化剤: アルキルアリアルポリグリコールエーテル 1重量部。

40

【0333】

活性化合物の好適な製剤を製造するため、活性化合物 1重量部を指定量の溶媒および乳化剤と混合し、得られた濃厚液を水で希釈して所望の濃度とする。保護活性を調べるため、若いキュウリ植物に指定の施用量で活性化合物製剤を噴霧する。処理から1日後、植物にスファエロテカ・フリギニア(Sphaerotheca fuliginea)の孢子懸濁液を接種する。次に、植物を、および相対大気湿度70%および温度23の温室に入れる。接種から7日後に評価を行う。0%は対照の効力に相当する効力を意味し、効力100%は完全が全く観察されないことを意味する。この試験では、下記の本発明の化合物が、活性化合物濃度500ppmで、70%以上の効力を示す。

50

【表 2】

化合物番号	効力 (%)
2	100
10	80
11	95
15	99
16	100
22	75
23	70
25	93

10

【0334】

実施例 Bアルタナリア (Alternaria) 試験 (トマト) / 保護

溶媒：N, N - ジメチルホルムアミド 49 重量部

乳化剤：アルキルアリアルポリグリコールエーテル 1 重量部。

20

【0335】

活性化合物の好適な製剤を製造するため、活性化合物 1 重量部を指定量の溶媒および乳化剤と混合し、得られた濃厚液を水で希釈して所望の濃度とする。保護活性を調べるため、若いトマト植物に指定の施用量で活性化合物の製剤を噴霧する。処理から 1 日後、植物にアルタナリア・ソラニ (Alternaria solani) の孢子懸濁液を接種し、相対湿度 100% および 22 で 24 時間置く。次に、植物を、相対大気湿度 96% および温度 20 に置く。接種から 7 日後に評価を行う。0% は対照の効力に相当する効力を意味し、効力 100% は感染が全く観察されないことを意味する。この試験では、本発明による下記化合物が、500 ppm の活性化合物濃度で、70% 以上の効力を示している。

【表 3】

30

化合物番号	効力 (%)
17	90
20	90

【0336】

実施例 Cピレノフォラ・テレス (Pyrenophora teres) 試験 (オオムギ) / 保護

40

溶媒：N, N - ジメチルホルムアミド 49 重量部

乳化剤：アルキルアリアルポリグリコールエーテル 1 重量部。

【0337】

活性化合物の好適な製剤を製造するため、活性化合物 1 重量部を指定量の溶媒および乳化剤と混合し、得られた濃厚液を水で希釈して所望の濃度とする。保護活性を調べるため、若い植物に指定の施用量で活性化合物の製剤を噴霧する。この処理から 1 日後、植物にピレノフォラ・テレス (Pyrenophora teres) の水系孢子懸濁液を噴霧する。植物を、20 および相対大気湿度 100% のインキュベーションキャビン中で 48 時間放置する。植物を、温度約 20 および相対大気湿度約 80% の温室に入れる。接

50

種から7から9日後に評価を行う。0%は対照の効力に相当する効力を意味し、効力100%は感染が全く観察されないことを意味する。この試験では、本発明による下記化合物が、500ppmの活性化合物濃度で、70%以上の効力を示している。

【表4】

化合物番号	効力 (%)
10	70
13	75
21	70
22	70
22	90

10

【0338】

実施例D

ピリクラリア (Pyricularia) 試験 (イネ) / 耐性誘発

溶媒：N,N-ジメチルホルムアミド49重量部

乳化剤：アルキルアリアルポリグリコールエーテル1重量部。

【0339】

20

活性化合物の好適な製剤を製造するため、活性化合物1重量部を指定量の溶媒および乳化剤と混合し、得られた濃厚液を水で希釈して所望の濃度とする。耐性誘発活性を調べるため、若いイネ植物に指定の施用量で活性化合物の製剤を噴霧する。処理の4日後、植物にピリクラリア・オリザエ (Pyricularia oryzae) の水系孢子懸濁液を接種し、相対大気湿度100%および26のインキュベーションキャビネット中に24時間置く。植物を、相対大気湿度80%および温度約26の温室に入れる。接種から7日後に評価を行う。0%は、対照の効力に相当する効力を意味し、効力100%は感染が全く観察されないことを意味する。この試験では、本発明による下記の化合物が、500ppmの活性化合物濃度で、70%以上の効力を示している。

【表5】

30

化合物番号	効力 (%)
1	70
10	80
12	80

【0340】

実施例E：スファエロテカ (Sphaerotheca) 試験 (キュウリ) / 保護

溶媒：N,N-ジメチルホルムアミド49重量部

乳化剤：アルキルアリアルポリグリコールエーテル1重量部。

40

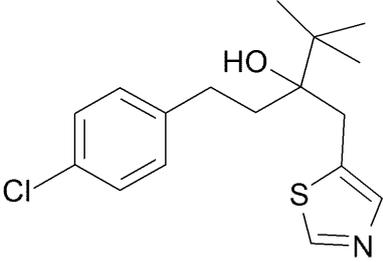
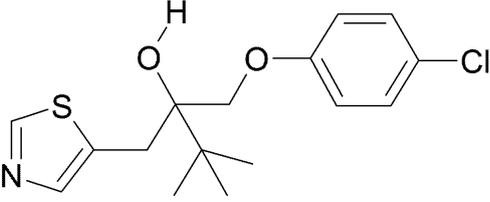
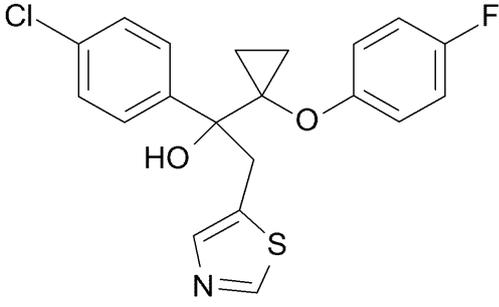
【0341】

活性化合物の好適な製剤を製造するため、活性化合物1重量部を指定量の溶媒および乳化剤と混合し、得られた濃厚液を水で希釈して所望の濃度とする。保護活性を調べるため、若いキュウリ植物に指定の施用量で活性化合物の製剤を噴霧する。処理の1日後、植物にスファエロテカ・フリギネア (Sphaerotheca fuliginea) の孢子懸濁液を接種する。次に、植物を相対大気湿度70%および温度23の温室に置く。接種から7日後に評価を行う。0%は、対照の効力に相当する効力を意味し、効力100%は感染が全く観察されないことを意味する。

【0342】

50

表
【表 6】

EP-A 395175からの公知の 活性化合物	ppm単位での 施用量	%単位での効 力
	100	8
	100	5
本発明による実施例2の活性化合物		
	100	93

10

20

30

【0343】

比較により、EP-A 395175から公知の化合物と比較して、本発明による化合物の効力に驚くべき顕著な改善がわかる。

【0344】

実施例F：ピレノフォラ・テレス (Pyrenophora teres) 試験 (オオムギ) / 保護

溶媒：N, N - ジメチルホルムアミド 49 重量部

乳化剤：アルキルアリアルポリグリコールエーテル 1 重量部。

40

【0345】

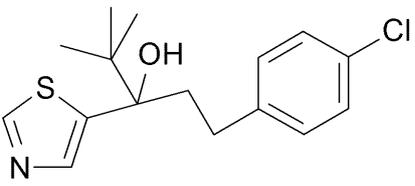
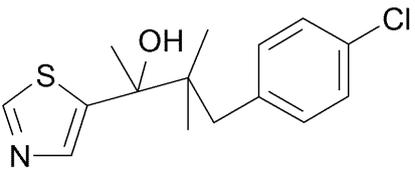
活性化合物の好適な製剤を製造するため、活性化合物 1 重量部を指定量の溶媒および乳化剤と混合し、得られた濃厚液を水で希釈して所望の濃度とする。保護活性を調べるため、若い植物に指定の施用量で活性化合物の製剤を噴霧する。この処理の1日後、植物にピレノフォラ・テレス (Pyrenophora teres) の水系孢子懸濁液を噴霧する。植物を 20 および相対大気湿度 100% のインキュベーションキャビンに 48 時間置いておく。植物を温度約 20 および相対大気湿度約 80% の温室に入れる。接種から 7 から 9 日後に評価を行う。0% は、対照の効力に相当する効力を意味し、効力 100% は感染が全く観察されないことを意味する。

【0346】

50

表

【表 7】

E P - A 4 0 9 4 1 8 からの公知の 活性化化合物	p p m 単位での 施用量	% 単位での効 力
	5 0 0	0
本発明による実施例 2 2 の活性化化合物		
	5 0 0	7 0

10

20

【 0 3 4 7 】

比較により、E P - A 4 0 9 4 1 8 から公知の不活性化化合物と比較して、本発明による化合物の驚くべき優越性がわかる。

【 0 3 4 8 】

実施例 G : ピリクラリア (P y r i c u l a r i a) 試験 (イネ) / 保護

溶媒 : N , N - ジメチルアセトアミド 4 9 重量部

乳化剤 : アルキルアールポリグリコールエーテル 1 重量部。

【 0 3 4 9 】

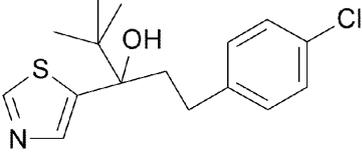
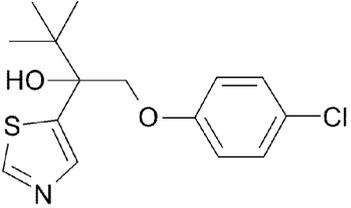
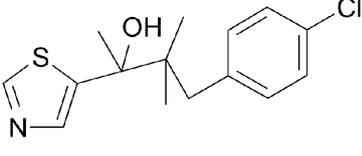
活性化化合物の好適な製剤を製造するため、活性化化合物 1 重量部を指定量の溶媒および乳化剤と混合し、得られた濃厚液を水で希釈して所望の濃度とする。保護活性を調べるため、若いイネ植物に指定の施用量で活性化化合物の製剤を噴霧する。噴霧コーティングが乾燥した後、植物にピリクラリア・オリザエ (P y r i c u l a r i a o r y z a e) の水系孢子懸濁液を接種し、相対大気湿度 1 0 0 % および 2 2 のインキュベーションキャビンに 4 8 時間置く。次に、相対大気湿度 1 0 0 % および温度約 2 2 の温室に植物を入れる。接種から 6 日後に評価を行う。0 % は、対照の効力に相当する効力を意味し、効力 1 0 0 % は感染が全く観察されないことを意味する。

30

【 0 3 5 0 】

表

【表 8】

EP-A409418からの公知の 活性化合物	ppm単位での 施用量	%単位での効 力
	1000	22
	1000	33
本発明による実施例22の活性化合物		
	1000	78

10

20

【0351】

比較により、EP-A409418から公知の化合物と比較して、本発明による化合物の効力に驚くべき顕著な改善がわかる。

【0352】

実施例H：ウロミセス（Uromyces）試験（マメ類）／保護

溶媒：アセトン24.5重量部

N,N-ジメチルアセトアミド24.5重量部。

30

【0353】

乳化剤：アルキルアールポリグリコールエーテル1重量部。

【0354】

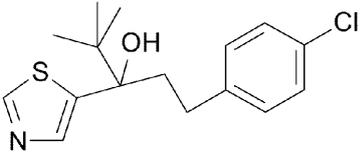
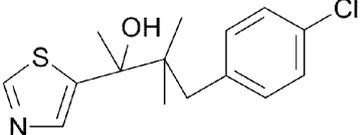
活性化合物の好適な製剤を製造するため、活性化合物1重量部を指定量の溶媒および乳化剤と混合し、得られた濃厚液を水で希釈して所望の濃度とする。保護活性を調べるため、若い植物に指定の施用量で活性化合物の製剤を噴霧する。噴霧コーティングが乾燥した後、植物にマメさび病菌（*Uromyces appendiculatus*）の水系孢子懸濁液を接種し、相対大気湿度100%および20のインキュベーションキャビンに1日置く。次に、相対大気湿度90%および温度約21の温室に植物を入れる。接種から10日後に評価を行う。0%は、対照の効力に相当する効力を意味し、効力100%は感染が全く観察されないことを意味する。

40

【0355】

表

【表 9】

EP-A409418からの公知の活性化合物	ppm単位での施用量	%単位での効力
	10	0
本発明による実施例22の活性化合物		
	10	80

10

【0356】

比較により、EP-A409418から公知の不活性化合物と比較して、本発明による化合物の驚くべき優越性がわかる。

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2012/073426

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D263/32 C07D277/24 A01N43/76 A01N43/78 ADD.		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 0 395 175 A2 (SHELL INT RESEARCH [NL]) 31 October 1990 (1990-10-31) cited in the application the whole document -----	1-11
Y	EP 0 409 418 A1 (ICI PLC [GB]) 23 January 1991 (1991-01-23) cited in the application the whole document -----	1-11
X	EP 2 177 496 A1 (ASSIST PUBL HOPITAUX DE PARIS [FR]; CENTRE NAT RECH SCIENT [FR]; UNIV) 21 April 2010 (2010-04-21) compounds III, IX ----- -/--	10
<input checked="" type="checkbox"/>	Further documents are listed in the continuation of Box C.	<input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.
* Special categories of cited documents :		
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance		"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date		"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)		"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means		"&" document member of the same patent family
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed		
Date of the actual completion of the international search 15 January 2013		Date of mailing of the international search report 24/01/2013
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Seelmann, Ingo

4

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2012/073426

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JOHN A. MURPHY ET AL: "Direct Conversion of N -Methoxy- N -methyamides (Weinreb Amides) to Ketones via a Nonclassical Wittig Reaction", ORGANIC LETTERS, vol. 7, no. 7, 1 March 2005 (2005-03-01), pages 1427-1429, XP055019373, ISSN: 1523-7060, DOI: 10.1021/o1050337b compound 20	10
X	----- JOHN M. HATCHER ET AL: "Catalytic Asymmetric Addition of Thiols to Nitrosoalkenes Leading to Chiral Non-Racemic [alpha]-Sulfonyl Ketones", ORGANIC LETTERS, vol. 13, no. 15, 5 August 2011 (2011-08-05), pages 3810-3813, XP055019370, ISSN: 1523-7060, DOI: 10.1021/o12012633 compound 38	10
X	----- MIEKO ARISAWA ET AL: "Rhodium-Catalyzed Organothio Exchange Reaction of [alpha]-Organothioketones with Disulfides", CHEMICAL & PHARMACEUTICAL BULLETIN, vol. 58, no. 10, 1 January 2010 (2010-01-01), pages 1349-1352, XP055019376, ISSN: 0009-2363, DOI: 10.1248/cpb.58.1349 abstract; compound 5	10
X	----- EP 0 112 292 A1 (CIBA GEIGY AG [CH]) 27 June 1984 (1984-06-27) claim 6; example H1	11
X	----- WO 2004/108684 A1 (SSP CO LTD [JP]; KONNO FUJIKO [JP]; KANEKO YASUSHI [JP]; HOSHIKADO TAK) 16 December 2004 (2004-12-16) compound 3	11
Y	abstract; claim 1 -----	1-11

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2012/073426

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0395175	A2	31-10-1990	AT 111089 T 15-09-1994 AU 627023 B2 13-08-1992 BR 9001928 A 30-07-1991 CA 2015380 A1 27-10-1990 CZ 279613 B6 17-05-1995 DE 69012197 D1 13-10-1994 DE 69012197 T2 02-02-1995 DK 0395175 T3 31-10-1994 EP 0395175 A2 31-10-1990 ES 2058752 T3 01-11-1994 HU 208318 B 28-09-1993 JP 2295983 A 06-12-1990 PL 284936 A1 26-08-1991 RU 2049782 C1 10-12-1995 US 5057529 A 15-10-1991
EP 0409418	A1	23-01-1991	EP 0409418 A1 23-01-1991 JP 3058979 A 14-03-1991
EP 2177496	A1	21-04-2010	EP 2177496 A1 21-04-2010 EP 2349966 A1 03-08-2011 WO 2010040730 A1 15-04-2010
EP 0112292	A1	27-06-1984	AR 242194 A1 31-03-1993 AU 568828 B2 14-01-1988 AU 2231083 A 21-06-1984 BR 8306862 A 24-07-1984 CA 1211450 A1 16-09-1986 DE 3372762 D1 03-09-1987 EP 0112292 A1 27-06-1984 ES 8601157 A1 16-02-1986 IL 70438 A 30-10-1987 JP 59116270 A 05-07-1984 PH 22319 A 29-07-1988 US 4610716 A 09-09-1986 ZA 8309261 A 29-08-1984
WO 2004108684	A1	16-12-2004	JP 2004359646 A 24-12-2004 WO 2004108684 A1 16-12-2004

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2012/073426

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES INV. C07D263/32 C07D277/24 A01N43/76 A01N43/78 ADD.		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE Recherchiertes Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) C07D A01N		
Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	EP 0 395 175 A2 (SHELL INT RESEARCH [NL]) 31. Oktober 1990 (1990-10-31) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument -----	1-11
Y	EP 0 409 418 A1 (ICI PLC [GB]) 23. Januar 1991 (1991-01-23) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument -----	1-11
X	EP 2 177 496 A1 (ASSIST PUBL HOPITAUX DE PARIS [FR]; CENTRE NAT RECH SCIENT [FR]; UNIV) 21. April 2010 (2010-04-21) Verbindungen III, IX ----- -/--	10
<input checked="" type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen <input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :		
A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist		*T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
E frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist		*X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)		*Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht		*Z* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist
P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts
15. Januar 2013		24/01/2013
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter Seelmann, Ingo

4

Formblatt PCT/ISA/210 (Blatt 2) (April 2005)

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2012/073426

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	JOHN A. MURPHY ET AL: "Direct Conversion of N -Methoxy- N -methyamides (Weinreb Amides) to Ketones via a Nonclassical Wittig Reaction", ORGANIC LETTERS, Bd. 7, Nr. 7, 1. März 2005 (2005-03-01), Seiten 1427-1429, XP055019373, ISSN: 1523-7060, DOI: 10.1021/o1050337b Verbindung 20	10
X	----- JOHN M. HATCHER ET AL: "Catalytic Asymmetric Addition of Thiols to Nitrosoalkenes Leading to Chiral Non-Racemic [alpha]-Sulfonyl Ketones", ORGANIC LETTERS, Bd. 13, Nr. 15, 5. August 2011 (2011-08-05), Seiten 3810-3813, XP055019370, ISSN: 1523-7060, DOI: 10.1021/o12012633 Verbindung 38	10
X	----- MIEKO ARISAWA ET AL: "Rhodium-Catalyzed Organothio Exchange Reaction of [alpha]-Organothioketones with Disulfides", CHEMICAL & PHARMACEUTICAL BULLETIN, Bd. 58, Nr. 10, 1. Januar 2010 (2010-01-01), Seiten 1349-1352, XP055019376, ISSN: 0009-2363, DOI: 10.1248/cpb.58.1349 Zusammenfassung; Verbindung 5	10
X	----- EP 0 112 292 A1 (CIBA GEIGY AG [CH]) 27. Juni 1984 (1984-06-27) Anspruch 6; Beispiel H1	11
X	----- WO 2004/108684 A1 (SSP CO LTD [JP]; KONNO FUJIKO [JP]; KANEKO YASUSHI [JP]; HOSHIKADO TAK) 16. Dezember 2004 (2004-12-16) Verbindung 3	11
Y	Zusammenfassung; Anspruch 1 -----	1-11

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2012/073426

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0395175	A2	31-10-1990	AT 111089 T 15-09-1994
			AU 627023 B2 13-08-1992
			BR 9001928 A 30-07-1991
			CA 2015380 A1 27-10-1990
			CZ 279613 B6 17-05-1995
			DE 69012197 D1 13-10-1994
			DE 69012197 T2 02-02-1995
			DK 0395175 T3 31-10-1994
			EP 0395175 A2 31-10-1990
			ES 2058752 T3 01-11-1994
			HU 208318 B 28-09-1993
			JP 2295983 A 06-12-1990
			PL 284936 A1 26-08-1991
			RU 2049782 C1 10-12-1995
			US 5057529 A 15-10-1991
EP 0409418	A1	23-01-1991	EP 0409418 A1 23-01-1991
			JP 3058979 A 14-03-1991
EP 2177496	A1	21-04-2010	EP 2177496 A1 21-04-2010
			EP 2349966 A1 03-08-2011
			WO 2010040730 A1 15-04-2010
EP 0112292	A1	27-06-1984	AR 242194 A1 31-03-1993
			AU 568828 B2 14-01-1988
			AU 2231083 A 21-06-1984
			BR 8306862 A 24-07-1984
			CA 1211450 A1 16-09-1986
			DE 3372762 D1 03-09-1987
			EP 0112292 A1 27-06-1984
			ES 8601157 A1 16-02-1986
			IL 70438 A 30-10-1987
			JP 59116270 A 05-07-1984
			PH 22319 A 29-07-1988
			US 4610716 A 09-09-1986
			ZA 8309261 A 29-08-1984
WO 2004108684	A1	16-12-2004	JP 2004359646 A 24-12-2004
			WO 2004108684 A1 16-12-2004

フロントページの続き

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
A 0 1 P 3/00 (2006.01)	C 0 7 C 49/255	
C 0 7 C 49/255 (2006.01)	C 0 7 C 49/233	
C 0 7 C 49/233 (2006.01)	C 0 7 D 303/34	
C 0 7 D 303/34 (2006.01)		

(81) 指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, T M), EP(AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, R S, SE, SI, SK, SM, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, H U, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI , NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC

(74) 代理人 100146318

弁理士 岩瀬 吉和

(74) 代理人 100127812

弁護士 城山 康文

(72) 発明者 ホフマン, セバスチヤン

ドイツ国、4 1 4 7 0・ノイス、ツュブレツセンヴェーク・1 2

(72) 発明者 ヘルムケ, ヘンドリツク

ドイツ国、6 5 8 3 5・リーデルーバツハ、ザム・モーゲングラーベン・2 2

(72) 発明者 ペリス, ゴルカ

ドイツ国、5 0 7 3 7・ケルン、メーアフェルトシュトラッセ・1 1

(72) 発明者 ニシング, カール・フリードリツヒ

ドイツ国、5 1 3 8 1・レパーケーゼン、ヒューシエンダー・シュトラッセ・3 8・ツエー

(72) 発明者 土屋 知己

フランス国、エフ - 6 9 0 0 9・リヨン、リュ・ジヤン・マリー・ルクレール・1 6

(72) 発明者 スダウ, アレキサンダー

ドイツ国、4 0 7 6 4・ランゲンフェルト、ロツハー・ヴェーグ・1 7・エフ

(72) 発明者 ベンテイング, ユルゲン

ドイツ国、4 2 7 9 9・ライヒリンゲン、アムゼルシュトラッセ・7

(72) 発明者 ベルニエ, デイビッド

フランス国、エフ - 6 9 0 0 4・リヨン、ケ・ジヨゼフ・ジレ・3 8

F ターム(参考) 4C033 AD10 AD17

4C048 AA01 BB17 CC01 UU02 XX01 XX04

4C056 AA01 AB01 AC02 AD01 AE03 BA08 BB01 BC01

4H006 AA01 AA03 AB03

4H011 AA01 BA01 BB10 BC03 BC06 BC07 DA15 DA16 DC05 DD03