

(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2010-513367

(P2010-513367A)

(43) 公表日 平成22年4月30日(2010.4.30)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
CO7D 405/06 (2006.01)	CO7D 405/06	CSP 4C063
AO1N 43/653 (2006.01)	AO1N 43/653	C 4H011
AO1P 3/00 (2006.01)	AO1P 3/00	

審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全 30 頁)

(21) 出願番号	特願2009-541953 (P2009-541953)	(71) 出願人	508020155
(86) (22) 出願日	平成19年12月4日 (2007.12.4)		ビーエーエスエフ ソシエタス・ヨーロッパ
(85) 翻訳文提出日	平成21年8月7日 (2009.8.7)		ア
(86) 国際出願番号	PCT/EP2007/063213		BASF SE
(87) 国際公開番号	W02008/077724		ドイツ連邦共和国 ルートヴィヒスハーフェン (番地なし)
(87) 国際公開日	平成20年7月3日 (2008.7.3)		D-67056 Ludwigshafen, Germany
(31) 優先権主張番号	06126995.7	(74) 代理人	100091096
(32) 優先日	平成18年12月22日 (2006.12.22)		弁理士 平木 祐輔
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)	(74) 代理人	100096183
			弁理士 石井 貞次
		(74) 代理人	100118773
			弁理士 藤田 節

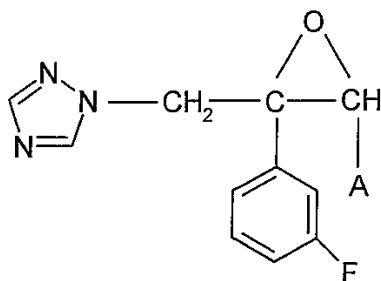
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 アゾリルメチルオキシラン、植物病原性菌類を防除するための前記化合物の使用、及び前記化合物を含む組成物

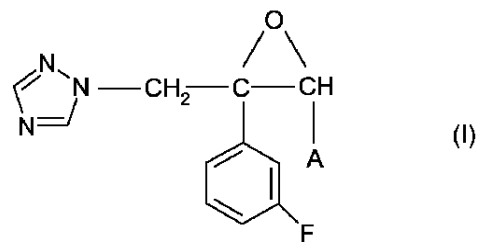
(57) 【要約】

本発明は、一般式(I)：

【化1】



(I)



(II)

(式中、Aは場合により1~3個の以下の置換基:ハロゲン、NO₂、アミノ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₁-C₄-アルキルアミノ、C₁-C₄-ジアルキルアミノ、チオまたはC₁-C₄-アルキルチオにより置換されているフェニルを表し、ただしAは2-メチルフェニルを表さない)

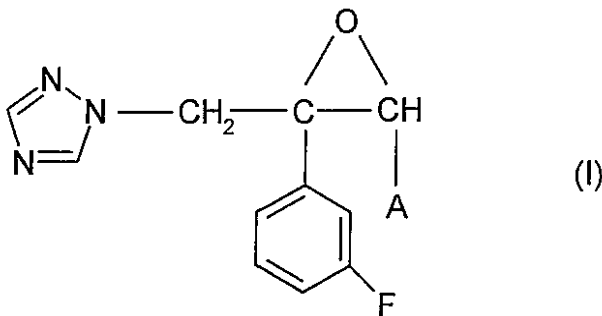
を有するアゾリルメチルオキシラン及びその植物適合性酸付加塩または金属塩、並びに植物病原性菌類を防除す

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 I:

【化 1】



10

(式中、A は1~3個の以下の置換基:ハロゲン、NO₂、アミノ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₁-C₄-アルキルアミノ、C₁-C₄-ジアルキルアミノ、チオまたはC₁-C₄-アルキルチオにより置換されていてもよいフェニルであるが、A は2-メチルフェニルでない)

を有するアゾリルメチルオキシラン、またはその植物適合性酸付加塩もしくは金属塩。

【請求項 2】

フェニル基が1~3個の以下の置換基:ハロゲン、NO₂、アミノ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₁-C₄-アルキルアミノ、C₁-C₄-ジアルキルアミノ、チオまたはC₁-C₄-アルキルチオにより置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

20

【請求項 3】

フェニル基が1~3個の以下の置換基:ハロゲン、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルキルまたはC₁-C₄-ハロアルコキシにより置換されている、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

フェニル基が1~3個の以下の置換基:ハロゲン、C₁-C₄-アルキルまたはC₁-C₄-アルコキシにより置換されている、請求項 3 に記載の化合物。

30

【請求項 5】

植物病原性菌類を防除するための請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の式 I を有する化合物、またはその酸付加塩もしくは金属塩の使用。

【請求項 6】

固体または液体担体及び請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の式 I を有する化合物及び/またはその酸付加塩もしくは金属塩を含む作物保護組成物。

【請求項 7】

少なくとも1種の請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の式 I を有する化合物及び/またはその酸付加塩もしくは金属塩を含む種子。

【請求項 8】

植物病原性菌類、または菌類の攻撃から保護しようとする材料、植物、土壌もしくは種子を有効量の請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の式 I を有する化合物、またはその酸付加塩もしくは金属塩で処理する、前記菌類の防除方法。

40

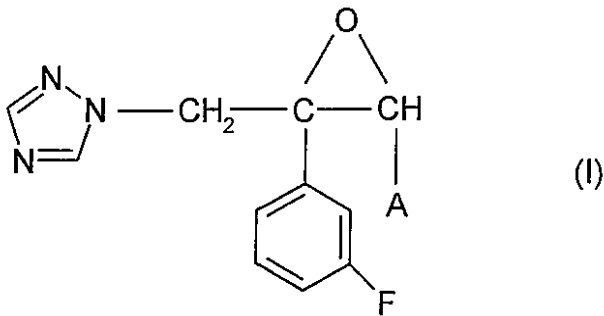
【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、一般式 I:

【化1】



10

(式中、Aは場合により1~3個の以下の置換基:ハロゲン、NO₂、アミノ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₁-C₄-アルキルアミノ、C₁-C₄-ジアルキルアミノ、チオまたはC₁-C₄-アルキルチオにより置換されているフェニルであり、ただしAは2-メチルフェニルでない)を有するアゾリルメチルオキシラン、及びその植物適合性酸付加塩または金属塩に関する。

【0002】

更に、本発明は、式Iを有する化合物の植物病原性菌類を防除するための使用及び前記化合物を含む組成物に関する。

【背景技術】

20

【0003】

アゾリルメチルオキシラン、その製造及びその作物保護における使用は、例えば特許文献1及び特許文献2から公知である。

【0004】

オキシラン環にヘタリール置換基を有するアゾリルメチルオキシランは特許文献3から公知である。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0005】

【特許文献1】欧州特許出願公開第0 094 564号

30

【特許文献2】欧州特許出願公開第0 196 038号

【特許文献3】欧州特許出願公開第0 421 125号

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0006】

既知のアゾリルメチルオキシランは多くの病原体に対して非常に良好な殺菌活性を有している。しかしながら、本発明の目的は、改善された殺菌活性を有する新規なアゾリルメチルオキシランを提供することであった。

【課題を解決するための手段】

【0007】

40

この目的は、最初に記載されている式Iを有する化合物により達成された。

【発明を実施するための形態】

【0008】

化合物Iは、窒素原子の塩基性のために無機または有機酸、或いは金属イオンと塩または付加物を形成し得る。

【0009】

無機酸の例は、ハロゲン化水素酸(例:フッ化水素、塩化水素、臭化水素及びヨウ化水素)、炭酸、硫酸、リン酸及び硝酸である。

【0010】

適当な有機酸は、例えばギ酸及びアルカン酸(例:酢酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ

50

酢酸及びプロピオン酸)、並びにグリコール酸、チオシアン酸、乳酸、コハク酸、クエン酸、安息香酸、ケイ皮酸、シュウ酸、アルキルスルホン酸(1~20個の炭素原子を持つ直鎖または分岐状アルキル基を有するスルホン酸)、アリールスルホン酸またはアリールジスルホン酸(1または2個のスルホン酸基を有するフェニルやナフチルのような芳香族基)、アルキルホスホン酸(1~20個の炭素原子を持つ直鎖または分岐状アルキル基を有するホスホン酸)、アリールホスホン酸またはアリールジホスホン酸(1または2個のホスホン酸基を有するフェニルやナフチルのような芳香族基)であり、前記アルキルまたはアリール基はp-トルエンスルホン酸、サリチル酸、p-アミノサリチル酸、2-フェノキシ安息香酸、2-アセトキシ安息香酸等のように追加置換基を有していてもよい。

【0011】

適当な金属イオンは、特に第2族元素(具体的には、カルシウム及びマグネシウム)、第3及び第4族典型元素(具体的には、アルミニウム、錫及び鉛)、及び第1~8遷移元素(具体的には、クロム、マンガン、鉄、コバルト、ニッケル、銅、亜鉛等)のイオンである。第4周期の遷移元素の金属イオンが特に好ましい。金属は考えられ得る様々な原子価で存在し得る。

【0012】

式Iを有する化合物の製造は公知であり、欧州特許出願公開第0 094 564号、欧州特許出願公開第0 196 038号及び欧州特許出願公開第0 421 125号に詳細に記載されている。

【0013】

上記式中に記載されている記号の定義では、通常以下の置換基を表す総称を使用した。

【0014】

ハロゲン: フッ素、塩素、臭素及びヨウ素。

【0015】

アルキル及び複合基(例えば、アルキルアミノ)のアルキル部分: 飽和の直鎖または分岐状炭化水素基、好ましくは1~4個の炭素原子を有するもの、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-メチルプロピル及び1,1-ジメチルエチル。

【0016】

ハロアルキル: 上記したアルキル基中の水素原子の一部または全部が上記したハロゲン原子で置換されているもの。1つの実施形態では、アルキル基は特定のハロゲン原子、好ましくはフッ素、塩素または臭素により少なくとも1回または完全に置換されている。更なる実施形態では、アルキル基は異なるハロゲン原子で部分的または完全にハロゲン化されている。混合ハロゲンにより置換されている場合には塩素とフッ素の組合せが好ましい。特に、(C₁-C₄)-ハロアルキルが好ましく、(C₁-C₂)-ハロアルキル、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-2,2-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または1,1,1-トリフルオロプロパ-2-イルがより好ましい。

【0017】

アルコキシ: 酸素を介して結合しており、好ましくは1~4個の炭素原子を有する上に定義したアルキル基。好ましいアルコキシ基の例はメトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、ブトキシ、1-メチルプロポキシ、2-メチルプロポキシまたは1,1-ジメチルエトキシである。

【0018】

ハロアルコキシ: ハロアルキルで上記したように、上に定義したアルコキシ基中の水素原子の一部または全部がハロゲン原子、特にフッ素、塩素または臭素により置換されているもの。好ましいハロアルコキシ基の例はOCH₂F、OCHF₂、OCF₃、OCH₂Cl、OCHCl₂、OCCl₃、クロロフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、2-

10

20

30

40

50

フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブromoエトキシ、2-ヨードエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2-フルオロエトキシ、2-クロロ-2,2-ジフルオロエトキシ、2,2-ジクロロ-2-フルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ、 OC_2F_5 、2-フルオロプロポキシ、3-フルオロプロポキシ、2,2-ジフルオロプロポキシ、2,3-ジフルオロプロポキシ、2-クロロプロポキシ、3-クロロプロポキシ、2,3-ジクロロプロポキシ、2-ブromoプロポキシ、3-ブromoプロポキシ、3,3,3-トリフルオロプロポキシ、3,3,3-トリクロロプロポキシ、 $OCH_2-C_2F_5$ 、 $OCF_2-C_2F_5$ 、1-(CH_2F)-2-フルオロエトキシ、1-(CH_2Cl)-2-クロロエトキシ、1-(CH_2Br)-2-ブromoエトキシ、4-フルオロブトキシ、4-クロロブトキシ、4-ブromoブトキシまたはノナフルオロブトキシである。

【0019】

アルキルチオ：硫黄原子を介して結合している上に定義したアルキル。

【0020】

式Iを有する新規化合物はキラル中心を含有しており、通常ラセミ化合物の形態またはエリト形とトレオ形のジアステレオマー混合物として得られる。本発明の化合物のエリトジアステレオマー及びトレオジアステレオマーは、例えば溶解度の違いに基づいてまたはカラムクロマトグラフィーにより分離され、純粋な形態で単離され得る。公知の方法により、ジアステレオマーの均一对を使用すると、均一なエナンチオマーが得られ得る。抗微生物剤として使用するには、合成で得られる均一なジアステレオマーまたはエナンチオマー及びその混合物が適当である。このことは殺菌組成物に対しても同様にあてはまる。

【0021】

本発明の化合物は生物活性が異なり得る各種結晶変態で存在し得る。これらも本発明により提供される。

【0022】

本発明の式Iを有する化合物または本発明に従って使用される式Iを有する化合物において、それぞれ単独でまたは組合せでの置換基が以下の意味を有していることが特に好ましい。ここで、適当ならば好ましい置換基または好ましい置換基の組合せが本発明の化合物の前駆体に対しても同様にあてはまる。

【0023】

置換基Aは、場合により1~3個の以下の置換基：ハロゲン、 NO_2 、アミノ、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、 C_1-C_4 -ジアルキルアミノ、チオまたは C_1-C_4 -アルキルチオにより置換されているフェニルである。

【0024】

更なる実施形態において、置換基Aは1~3個の以下の置換基：ハロゲン、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルキルまたは C_1-C_4 -ハロアルコキシにより置換されているフェニルである。

【0025】

好ましい実施形態において、置換基Aは1~3個のハロゲンにより置換されているフェニルである。

【0026】

特に使用の点から、下表1にまとめられている本発明の化合物Iが好ましい。表中で置換基に対して挙げられている基は更にそれ自体当該置換基の特に好ましい実施形態である。

10

20

30

40

【表1】

表1:

化合物	置換基A
1-1	3-メチルフェニル
1-2	4-メチルフェニル
1-3	2-メトキシフェニル
1-4	3-メトキシフェニル
1-5	4-メトキシフェニル
1-6	2-クロロフェニル
1-7	3-クロロフェニル
1-8	4-クロロフェニル
1-9	2-フルオロフェニル
1-10	3-フルオロフェニル
1-11	4-フルオロフェニル
1-12	2-クロロ-3-メトキシフェニル
1-13	2-クロロ-4-メトキシフェニル
1-14	2,3-ジクロロフェニル
1-15	2,4-ジクロロフェニル
1-16	3,4-ジクロロフェニル
1-17	2,3-ジフルオロフェニル
1-18	2,4-ジフルオロフェニル
1-19	2-クロロ-3-フルオロフェニル
1-20	2-クロロ-4-フルオロフェニル

10

20

【0027】

化合物Iは殺菌剤として適当である。これらの化合物は、子の菌類(Ascomycete)、不完全菌類(Deuteromycete)、卵菌類(Oomycete)及び担子菌類(Basidiomycete)の綱、特に卵菌類の綱の植物病原性菌類の広いスペクトルに対する優れた活性により区別される。これらの化合物の幾つかは浸透的に有効であり、葉面殺菌剤として、種子粉衣用殺菌剤として、土壌殺菌剤として作物保護において使用され得る。

30

【0028】

化合物Iは、各種農作物、例えば小麦、ライ麦、大麦、ライ小麦、オート麦、イネ、トウモロコシ、牧草、バナナ、ワタ、ダイズ、コーヒー、サトウキビ、ブドウ、果実及び観賞植物、及び野菜、例えば、キュウリ、インゲンマメ、トマト、ジャガイモ及びカボチャ、並びにこれらの植物の種子について多くの菌類の防除において特に重要である。これらの化合物は、遺伝子工学方法を含めた育種のおかげで昆虫または菌類の攻撃、或いは除草剤の施用に対して耐性の作物においても使用され得る。加えて、これらの化合物は、特に木またはブドウの蔓の根を攻撃するボトリオスファエリア(Botryosphaeria)属の種、シリンドロカルボン(Cylindrocarpon)属の種、ユウチパ・ラタ(Eutypa lata)、ネオネクトリア・リリオデンドリ(Neonectria liriodendri)及びステレウム・ヒルスタム(Stereum hirsutum)を防除するのに適している。

40

【0029】

化合物Iは、以下の植物病害を防除するために特に適している:

- 野菜、アブラナ、サトウダイコン、果実及びイネにつくアルテルナリア(Alternaria)属の種、例えばジャガイモ及びトマトにつくアルテルナリア・ソラニ(A.solani)またはアルテルナリア・アルテルナータ(A.alternata);
- サトウダイコン及び野菜につくアファノマイセス(Aphanomyces)属の種;
- 穀類及び野菜につくアスコチタ(Ascochyta)属の種;
- トウモロコシ、穀類、イネ及び芝生につくビポラリス(Bipolaris)属の種及びドレクスレラ(Drechslera)属の種、例えばトウモロコシにつくドレクスレラ・マイデイス(D.maydis);

50

- 穀類につくブルメリア・グラミニス(*Blumeria graminis*) (うどんこ病) ;
- イチゴ、野菜、花卉及びブドウの蔓につくボトリチス・シネレア(*Botrytis cinerea*) (灰色カビ病) ;
- レタスにつくブレミア・ラクツカエ(*Bremia lactucae*) ;
- トウモロコシ、ダイズ、イネ及びサトウダイコンにつくサーコスボラ(*Cercospora*) 属の種 ;
- トウモロコシ、穀類及びイネにつくコクリオボラス(*Cochliobolus*) 属の種、例えば穀類につくコクリオボルス・サティブス(*Cochliobolus sativus*)、イネにつくコクリオボルス・ミヤビヤヌス(*Cochliobolus miyabeanus*) ;
- ダイズ及びワタにつくコレトトリクム(*Colletotricum*) 属の種 ; 10
- トウモロコシ、穀類、イネ及び芝生につくドレクスレラ(*Drechslera*) 属の種、フィレノフォラ(*Pyrenophora*) 属の種、例えば大麦につくドレクスレラ・テレス(*D. teres*) または小麦につくドレクスレラ・トリチシ・レペンティス(*D. tritici-repentis*) ;
- ファエオアクレモニウム・クラミドスポリウム(*Phaeoacremonium chlamydosporium*)、ファエオアクレモニウム・アレオフィルム(*Ph. Aleophilum*) 及びホルミチボラ・プンクタタ(*Formitipora punctata*) (フェニヌス・プンクタツス(*Phellinus punctatus*) と同義) に起因するブドウの蔓につくエスカ ;
- トウモロコシにつくエクセロヒルム(*Exserohilum*) 属の種 ;
- ウリ科植物につくエリシフェ・シコラセアルム(*Erysiphe cichoracearum*) 及びスファエロテカ・フリジネア(*Sphaerotheca fuliginea*) ; 20
- 各種植物につくフザリウム(*Fusarium*) 属の種及びバーティシリウム(*Verticillium*) 属の種、例えば穀類につくフザリウム・グラミネアルム(*F. graminearum*) またはフザリウム・クルモラム(*F. culmorum*)、または多数の植物(例えば、トマト)につくフザリウム・オキシスポラム(*F. oxysporum*) ;
- 穀類につくガエウマノマイセス・グラミニス(*Gaeumanomyces graminis*) ;
- 穀類及びイネにつくジベレラ(*Gibberella*) 属の種、例えばイネにつくジベレラ・フジクロイ(*Gibberella fujikuroi*) ;
- イネにつく穀粒染色複合体(*grain staining complex*) ;
- トウモロコシ及びイネにつくヘルミントスポリウム(*Helminthosporium*) 属の種 ;
- 穀類につくミクロドシウム・ニバレ(*Microdochium nivale*) ; 30
- 穀類、バナナ及び落花生につくマイコスファエレラ(*Mycosphaerella*) 属の種、例えば小麦につくマイコスファエレラ・グラミニコラ(*M. graminicola*)、またはバナナにつくマイコスファエレラ・フィジエンシス(*M. fijiensis*) ;
- キャベツ及び球根植物につくペロノスポラ(*Peronospora*) 属の種、例えばキャベツにつくペロノスポラ・ブラシカエ(*P. brassicae*)、またはタマネギにつくペロノスポラ・デストラクトル(*P. destructor*) ;
- ダイズにつくファコプサラ・パシリジイ(*Phakopsara pachyrhizi*) 及びファコプサラ・メイボミアエ(*Phakopsara meibomiaae*) ;
- ダイズ及びヒマワリにつくホモプシス(*Phomopsis*) 属の種 ;
- ジャガイモ及びトマトにつくフィトフトラ・インフェスタンス(*Phytophthora infestans*) ; 40
- 各種植物につくフィトフトラ(*Phytophthora*) 属の種、例えばシシトウガラシにつくフィトフトラ・カプシシ(*P. capsici*) ;
- ブドウの蔓につくプラスモパラ・ビチコラ(*Plasmopara viticola*) ;
- リンゴにつくポドスファエラ・ロイコトリカ(*Podosphaera leucotricha*) ;
- 穀類につくシュードセルコスボレラ・ヘルボトリコイデス(*Pseudocercospora herpotrichoides*) ;
- 各種植物につくシュードペロノスポラ(*Pseudoperonospora*)、例えばキュウリにつくシュードペロノスポラ・クベンシス(*P. cubensis*)、またはホップにつくシュードペロノスポラ・ヒュミリ(*P. humili*) ; 50

- 各種植物につくブッシニア(*Puccinia*)属の種、例えば穀類につくブッシニア・トリティシナ(*P.triticina*)、ブッシニア・ストリホルミンズ(*P.striformis*)、ブッシニア・ホルディ(*P.hordei*)またはブッシニア・グラミニス(*P.graminis*)、またはアスパラガスにつくブッシニア・アスパラギ(*P.asparagi*) ;
- イネにつくピリクラリア・オリザエ(*Pyricularia oryzae*)、コルティシウム・ササキ(*Corticium sasakii*)、サロクラディウム・オリザエ(*Sarocladium oryzae*)、サロクラディウム・アテヌアタム(*S.attenuatum*)、及びイネにつくエンティロマ・オリザエ(*Entylo ma oryzae*) ;
- 芝生及び穀類につくピリクラリア・グリセア(*Pyricularia grisea*) ;
- 芝生、イネ、トウモロコシ、ワタ、アブラナ、ヒマワリ、サトウダイコン、野菜及び他の植物につくフィチウム(*Pythium*)属の種、例えば各種植物につくフィチウム・ウルチウム(*P.ultiumum*)、または芝生につくフィチウム・アフアニデルマタム(*P.aphanidermatum*) ;
- ワタ、イネ、ジャガイモ、芝生、トウモロコシ、アブラナ、ジャガイモ、サトウダイコン、野菜及び各種植物につくりゾクトニア(*Rhizoctonia*)属の種、例えばサトウダイコン及び各種植物につくりゾクトニア・ソラニ(*R.solani*) ;
- 大麦、ライ麦及びライ小麦につくりンコスפורウム・セカリス(*Rhynchosporium secalis*) ;
- アブラナ及びヒマワリにつくスクレロティニア(*Sclerotinia*)属の種 ;
- 小麦につくセプトリア・トリティシ(*Septoria tritici*)及びスタゴノスポラ・ノドルム(*Stagonospora nodorum*) ;
- ブドウの蔓につくエリシフェ(*Erysiphe*) (ウンキヌラ(*Uncinula*)と同義)・ネカトール(*necator*) ;
- トウモロコシ及び芝生につくセトスパリア(*Setospaeria*)属の種 ;
- トウモロコシにつくスファセロセカ・レイリニア(*Sphacelotheca reilinia*) ;
- ダイズ及びワタにつくチエバリオプシス(*Thievaliopsis*)属の種 ;
- 穀類につくティレチア(*Tilletia*)属の種 ;
- 穀類、トウモロコシ及びサトウダイコンにつくウスチラゴ(*Ustilago*)属の種、例えばトウモロコシにつくウスチラゴ・マイディス(*U.maydis*) ;
- リンゴ及びナシにつくベンチュリア(*Venturia*)属の種(黒星病)、例えばリンゴにつくベンチュリア・イナエクアリス(*V.inaequalis*)。

【0030】

化合物Iは、ペロノスポロマイセテス(*Peronosporomycetes*) (卵菌類と同義語)の網の有害菌類、例えばペロノスポラ(*Peronospora*)属の種、フィトフトラ(*Phytophthora*)属の種、プラスモパラ・ピチコラ(*Plasmopara viticola*)、シュードペロノスポラ(*Pseudoperonospora*)属の種、及びピシウム(*Pythium*)属の種を防除するために特に適している。

【0031】

化合物Iは、材料(例えば、木材、紙、塗料分散物、繊維またはファブリック)の保護及び貯蔵品の保護において有害菌類を防除するためにも適している。木材の保護では、以下の有害菌類:子のう菌類、例えばオフィオストマ(*Ophiostoma*)属の種、セラトシスチス(*Ceratocystis*)属の種、アウレオバシジウム・プルランス(*Aureobasidium pullulans*)、スクレオフォーマ(*Sclerophoma*)属の種、ケトミウム(*Chaetomium*)属の種、フミコラ(*Hemicola*)属の種、ペトリエラ(*Petriella*)属の種、トリクルス(*Trichurus*)属の種;担子菌類、例えばコニオフォーラ(*Coniophora*)属の種、コリオルス(*Coriolus*)属の種、グロエオフィルム(*Gloeophyllum*)属の種、レンティヌス(*Lentinus*)属の種、プレウロタス(*Pleurotus*)属の種、ポリア(*Poria*)属の種、セルプラ(*Serpula*)属の種、及びチロマイセス(*Tyromyces*)属の種;不完全菌類、例えばアスペルギルス(*Aspergillus*)属の種、クラドスポリウム(*Cladosporium*)属の種、ペニシリウム(*Penicillium*)属の種、トリコデルマ(*Trichoderma*)属の種、アルテルナリア(*Alternaria*)属の種、ペシロマイセス(*Paecilomyces*)属の種;及び接合菌類(*Zygomycetes*)、例えばムコール(*Mucor*)属の種に特に注

意を払う。加えて、材料を保護するには以下の酵母:カンジダ(Candida)属の種及びサッカロミセス・セレビスエ(Saccharomyces cerevisiae)に特に注意を払う。

【0032】

化合物Iは、菌類、または菌類の攻撃から保護しようとする植物、種子もしくは材料、または土壌を殺菌有効量の活性化合物で処理することにより使用される。材料、植物または種子が菌類により感染する前及び後に施用され得る。

【0033】

殺菌組成物は通常0.1~95重量%、好ましくは0.5~90重量%の活性化合物を含む。

【0034】

作物保護において使用する場合、施用量は所望する効果の種類に依存し、1haあたり0.01~2.0kgの活性化合物である。 10

【0035】

種子処理の場合、活性化合物の所要量は通常種子100kgあたり1~1000g、好ましくは5~100gである。

【0036】

材料または貯蔵品の保護に使用する場合、活性化合物の施用量は施用エリアの種類及び所望する効果に依存する。材料の保護における典型的な施用量は、例えば処理する材料1cm³あたり0.001g~2kg、好ましくは0.005g~1kgの活性化合物である。

【0037】

式Iを有する化合物は生物学的活性の点で異なり得るいろいろな結晶変態で存在し得る。これらも本発明の主題である。 20

【0038】

化合物Iは慣用の製剤、例えば溶液剤、エマルジョン剤、サスペンション剤、粉剤、散剤、ペースト剤及び顆粒剤に変換され得る。施用形態は具体的目的に依存する。いずれの場合も、本発明の化合物は微細且つ均一に分布されなければならない。

【0039】

製剤は公知の方法で、例えば活性化合物を溶媒及び/または担体を用いて、所望により乳化剤及び分散剤を用いて増量することにより製造される。この目的に適した溶媒/助剤は、本質的に

-水、芳香族溶媒(例:Solvesso製品、キシレン)、パラフィン(例:鉱油画分)、アルコール(例:メタノール、ブタノール、ペンタノール、ベンジルアルコール)、ケトン(例:シクロヘキサノン、 γ -ブチロラクトン)、ピロリドン(NMP、NOP)、アセテート(グリコールジアセテート)、グリコール、脂肪酸ジメチルアミド、脂肪酸及び脂肪酸エステル。原則として、溶媒混合物も使用可能である; 30

-担体、例えば粉碎天然鉱物(例:カオリン、クレイ、タルク、チョーク)及び粉碎合成鉱物(例:微粉碎シリカ、シリケート);乳化剤、例えば非イオン性及びアニオン性乳化剤(例:ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル、アルキルスルホネート及びアリアルスルホネート);及び分散剤、例えばリグノ亜硫酸塩廃液及びメチルセルロース;である。

【0040】

界面活性剤として使用するためには、リグノスルホン酸、ナフタレンスルホン酸、フェノールスルホン酸、ジブチルナフタレンスルホン酸のアルカリ金属、アルカリ土類金属及びアンモニウム塩、アルキルアリアルスルホネート、アルキルスルフェート、アルキルスルホネート、脂肪アルコールスルフェート、脂肪酸及び硫酸化脂肪アルコールグリコールエーテル;更にはスルホン化ナフタレン及びナフタレン誘導体とホルムアルデヒドの縮合物、ナフタレンまたはナフタレンスルホン酸とフェノール及びホルムアルデヒドの縮合物、ポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテル、エトキシ化イソオクチルフェノール、オクチルフェノール、ノニルフェノール、アルキルフェニルポリグリコールエーテル、トリブチルフェニルポリグリコールエーテル、トリステアリルフェニルポリグリコールエーテル、アルキルアリアルポリエーテルアルコール、アルコール及び脂肪アルコールエチ 40 50

レンオキシド縮合物、エトキシ化ヒマシ油、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、エトキシ化ポリオキシプロピレン、ラウリルアルコールポリグリコールエーテルアセター、ソルビトールエステル、リグノ亜硫酸塩廃液及びメチルセルロースが適当である。

【0041】

直接噴霧可能な溶液剤、エマルジョン剤、ペースト剤またはオイルディスパーション剤を製造するためには、中～高沸点を有する鉱油画分、例えばケロセンまたはディーゼル油；更にはコールタール油、及び植物または動物起源の油、脂肪族、環式及び芳香族炭化水素、例えばトルエン、キシレン、パラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化ナフタレンまたはその誘導体、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、シクロヘキサノール、シクロヘキサノン、イソホロン、強極性溶媒(例：ジメチルスルホキシド、N-メチルピロリドン及び水)が適当である。

10

【0042】

散剤、展着用材料及び吐粉性製品は、活性物質と固体担体を混合または同時に粉碎することにより製造され得る。

【0043】

顆粒剤、例えば被覆顆粒剤、含浸顆粒剤及び均質顆粒剤は、活性化化合物を固体担体に結合させることにより製造され得る。固体担体の例は無機土類、例えばシリカゲル、シリケート、タルク、カオリン、アタクレ、石灰石、石灰、チョーク、膠灰粘土、黄土、クレ、ドロマイト、珪藻土、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウム；粉碎合成材料；肥料、例えば硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素；及び植物起源の製品、例えば穀粉、樹皮粉、木粉及び堅果穀粉；セルロース粉末及び他の固体担体である。

20

【0044】

通常、製剤は0.01～95重量%、好ましくは0.1～90重量%の活性化化合物を含んでいる。活性化化合物は(NMRスペクトルに従って)90%～100%、好ましくは95%～100%の純度で使用される。

【0045】

製剤の例を以下に示す：

1. 水で希釈するための製品

A 液剤(Water-soluble concentrates)(SL、LS)

30

10重量部の活性化化合物を90重量部の水または水溶性溶媒に溶解させる。代替として、湿潤剤または他の助剤を添加する。水で希釈すると活性化化合物は溶解する。これにより、活性化化合物含量が10重量%の製剤が得られる。

【0046】

B 分散製剤(Dispersible concentrates)(DC)

20重量部の活性化化合物を10重量部の分散剤(例えば、ポリビニルピロリドン)を添加した70重量部のシクロヘキサノン中に溶解させる。水で希釈すると分散液が得られる。活性化化合物含量は20重量%である。

【0047】

C 乳剤(Emulsifiable concentrates)(EC)

40

15重量部の活性化化合物をドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及びヒマシ油エトキシレート(それぞれ5重量部)を添加した75重量部のキシレン中に溶解させる。水で希釈すると乳濁液が得られる。製剤は15重量%の活性化化合物含量を有している。

【0048】

D エマルジョン剤(Emulsions)(EW、EO、ES)

25重量部の活性化化合物をドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及びヒマシ油エトキシレート(それぞれ5重量部)を添加した35重量部のキシレン中に溶解させる。この混合物を30重量部の水に乳化機(例えば、Ultraturrax)を用いて添加し、均質な乳濁液とする。水で希釈すると乳濁液が得られる。製剤は25重量%の活性化化合物含量を有している。

【0049】

50

E 懸濁製剤(Suspensions)(SC、OD、FS)

10重量部の分散剤及び湿潤剤及び70重量部の水または有機溶媒を添加して20重量部の活性化合物を攪拌型ボールミルにおいて粉碎して、微細な活性化合物懸濁液を得る。水で希釈すると活性化合物の安定な懸濁液が得られる。製剤中の活性化合物含量は20重量%である。

【0050】

F 顆粒水和剤(Water-dispersible granules)及び顆粒水溶剤(water-soluble granules)(WG、SG)

50重量部の分散剤及び湿潤剤を添加して50重量部の活性化合物を微細に粉碎し、器具(例えば、押出機、噴霧塔、流動床)を用いて水和性または水溶性顆粒剤とする。水で希釈すると活性化合物の安定な分散液または溶液が得られる。製剤は50重量%の活性化合物含量を有している。

【0051】

G 粉末水和剤(Water-dispersible powders)及び粉末水溶剤(water-soluble powders)(WP、SP、SS、WS)

25重量部の分散剤及び湿潤剤及びシリカゲルを添加して75重量部の活性化合物をローター-ステーターミルにおいて粉碎する。水で希釈すると活性化合物の安定な分散液または溶液が得られる。製剤の活性化合物含量は75重量%である。

【0052】

H ゲル製剤(GF)

20重量部の活性化合物、10重量部の分散剤、1重量部のゲル化剤及び70重量部の水または有機溶媒をボールミルにおいて粉碎すると、微細な懸濁液が得られる。水で希釈すると20重量%の活性化合物含量を有する安定な懸濁液が得られる。

【0053】

2. 希釈せずに施用する製品

I 粉剤(Dusts)(DP、DS)

5重量部の活性化合物を95重量部の微細なカオリンと微粉碎し、均密に混合粉碎する。これにより、5重量%の活性化合物含量を有する吐粉性製品が得られる。

【0054】

J 粒剤(Granules)(GR、FG、GG、MG)

0.5重量部の活性化合物を微粉碎し、99.5重量部の担体と混合する。一般的な方法は押し出し、噴霧乾燥及び流動床である。これにより、0.5重量%の活性化合物含量を有する希釈せずに施用する粒剤が得られる。

【0055】

K ULV液剤(UL)

10重量部の活性化合物を90重量部の有機溶媒(例えば、キシレン)中に溶解させる。こうすると、10重量%の活性化合物含量を有する希釈せずに施用する製品が得られる。

【0056】

種子を処理するためには、通常、液剤(LS)、懸濁製剤(FS)、粉剤(DS)、粉末水和剤及び粉末水溶剤(WS、SS)、エマルジョン剤(ES)、乳剤(EC)及びゲル剤(GF)が使用される。これらの製剤は希釈せずにまたは希釈した形態で種子に施用され得るが、後者が好ましい。播種前に施用することができる。

【0057】

活性化合物はそのまま、製剤の形態、または製剤から作成した使用形態、例えば直接噴霧可能な溶液、粉末、懸濁液または分散液、乳濁液、オイルディスパージョン、ペースト、吐粉性製品、展着用材料または顆粒剤の形態で噴霧、アトマイジング、散粉、展着または注入により使用され得る。使用形態は完全に意図する目的に依存する。いずれの場合も、本発明の活性化合物をできる限り微細に分布することが意図されている。

【0058】

水性使用形態は、乳剤、ペースト剤または水和剤(噴霧可能な粉末、オイルディスパー

10

20

30

40

50

ジョン) から水を添加することにより調製され得る。乳濁液、ペーストまたはオイルディ
スパージョンを製造するためには、そのまま、または油または溶媒に溶解させた物質を湿
潤剤、増粘剤、分散剤または乳化剤を用いて水中にホモジナイズさせ得る。或いは、活性
物質、湿潤剤、増粘剤、分散剤または乳化剤、適当ならば溶媒または油からなる濃厚物を
調製することができ、この濃厚物は水で希釈するために適している。

【0059】

すぐに使用できる製剤中の活性化化合物濃度は比較的広範囲で変更可能である。通常、0.
0001~10%、好ましくは0.01~1%である。

【0060】

活性化化合物は極微量方法(ULV)でうまく使用され得、これにより95重量%以上の活性化
化合物を含む製剤を施用したり、または添加剤なしに活性化化合物を施用することさえできる
。

10

【0061】

活性化化合物に各種タイプの油、湿潤剤、佐剤、除草剤、殺菌剤、他の農薬または殺細菌
剤を添加してもよく、適当ならば使用直前に添加(タンクミックス)しなくてもよい。こ
れらの組成物は本発明の組成物と1:100~100:1、好ましくは1:10~10:1の重量比で混合さ
れ得る。

【0062】

有機的に改質したポリシロキサン、例えばBreak Thru S 240(登録商標);アルコールア
ルコキシレート、例えばAtplus 245(登録商標)、Atplus MBA 1303(登録商標)、Plurafa
c LF 300(登録商標)及びLutensol ON 30(登録商標);EO-POブロックポリマー、例えばPI
uronic RPE 2035(登録商標)及びGenapol B(登録商標);アルコールエトキシレート、例
えばLutensol XP80(登録商標);及びジオクチルスルホコハク酸ナトリウム、例えばLeoph
en RA(登録商標)が本発明における佐剤として特に適当である。

20

【0063】

殺菌剤としての施用形態の本発明の組成物に他の活性化化合物、例えば除草剤、殺虫剤、
生長調節剤、殺菌剤、または他に肥料と一緒に存在させてもよい。化合物Iまたは化合物I
を含む組成物を1種以上の追加活性化化合物(特に、殺菌剤)と混合すると、多くの場合、例
えば、活性スペクトルを広げたりまたは耐性の発現を防止することができる。多くの場合
、相乗効果が得られる。

30

【0064】

本発明は更に、少なくとも1種の式Iを有するアゾリルメチルオキシラン、特に本明細書
中に好ましいと開示されているアゾリルメチルオキシラン及び/またはその農業上許容さ
れる塩及び少なくとも1種の追加の殺菌、殺虫、除草及び/または生長調節活性化化合物の配
合剤を提供し、この配合剤により相乗効果を得ることができる。

【0065】

本発明はまた、少なくとも1種の式Iを有する化合物、特に本明細書中に好ましいと開示
されている式Iを有する化合物及び/またはその農業上許容される酸付加塩もしくは金属塩
ならびに少なくとも1種の固体または液体担体を含む農薬組成物も提供する。前記農薬組
成物は少なくとも1種の追加の殺菌、殺虫及び/または除草活性化化合物を含み得、相乗効果
を得ることができる。

40

【0066】

本発明の化合物と一緒に施用され得る殺菌剤の以下のリストは考えられる組合せを例示
することを意味しているが、これらに限定されるものではない。

【0067】

リストL

ストロビルリン

アゾキシストロピン、ジモキシストロピン、エネストロプリン、フルオキサストロピン、
クレソキシムメチル、メトミノストロピン、オリザストロピン、ピコキシストロピン、ピ
ラクロストロピン、ピリベンカルブ、トリフロキシストロピン、2-(2-(6-(3-クロロ-2-メ

50

チルフェノキシ)-5-フルオロピリミジン-4-イルオキシ)フェニル)-2-メトキシイミノ-N-メチルアセトアミド、2-(オルト-((2,5-ジメチルフェニルオキシメチレン)フェニル)-3-メトキシアクリル酸メチル、3-メトキシ-2-(2-(N-(4-メトキシフェニル)シクロプロパンカルボキシイミドイルスルファニルメチル)フェニル)アクリル酸メチル。

【0068】

カルボキサミド

-カルボキサニリド:ベナラキシル、ベナラキシル-M、ベノダニル、ピキサフェン、ボスカリド、カルボキシニル、フェンフラム、フェンヘキサミド、フルトラニル、フラメトピル、イソチアニル、キララキシル、メプロニル、メタラキシル、オフレース、オキサジキシル、オキシカルボキシニル、ペンチオピラド、テクロフタラム、チフルザミド、チアジニル、2-アミノ-4-メチルチアゾール-5-カルボキサニリド、2-クロロ-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)-ニコチンアミド、N-(3',4'-ジクロロ-5-フルオロピフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、N-[2-(1,3-ジメチルブチル)フェニル]-5-フルオロ-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、N-(4'-クロロ-3',5-ジフルオロピフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、N-(4'-クロロ-3',5-ジフルオロピフェニル-2-イル)-3-トリフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、N-(3',4'-ジクロロ-5-フルオロピフェニル-2-イル)-3-トリフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、N-(3',5-ジフルオロ-4'-メチルピフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、N-(3',5-ジフルオロ-4'-メチルピフェニル-2-イル)-3-トリフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、N-(2-ピシクロプロピル-2-イルフェニル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、N-(シス-2-ピシクロプロピル-2-イルフェニル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、N-(トランス-2-ピシクロプロピル-2-イルフェニル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド；

-カルボン酸モルホリド:ジメトモルフ、フルモルフ；

-ベンズアミド:フルメトパー、フルオピコリド、フルオピラム、ゾキサミド、N-(3-エチル-3,5,5-トリメチルシクロヘキシル)-3-ホルミルアミノ-2-ヒドロキシベンズアミド；

-他のカルボキサミド:カルプロパミド、ジクロシメット、マンジプロパミド、オキシテトラサイクリン、シルチオフラム、N-(6-メトキシピリジン-3-イル)シクロプロパンカルボキサミド。

10

20

30

【0069】

アゾール

-トリアゾール:アザコナゾール、ピテルタノール、プロムコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾール-M、エボキシコナゾール、フェンブコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホル、ヘキサコナゾール、イミベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、マイクロブタニル、オキスポコナゾール、パクロブトラゾール、ペンコナゾール、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、シメコナゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾール、ウニコナゾール、1-(4-クロロフェニル)-2-([1,2,4]トリアゾール-1-イル)-シクロヘプタノール；

-イミダゾール:シアゾファミド、イマザリル、イマザリル硫酸塩、ペフラゾエート、プロクロラズ、トリフルミゾール；

-ベンズイミダゾール:ベノミル、カルベンダジム、フベリダゾール、チアベンダゾール；

-その他:エタボキサム、エトリジアゾール、ヒメキサゾール、1-(4-クロロフェニル)-1-(プロピン-2-イルオキシ)-3-(4-(3,4-ジメトキシフェニル)イソオキサゾール-5-イル)プロパン-2-オン。

40

【0070】

窒素含有ヘテロシクリル化合物

-ピリジン:フルアジナム、ピリフェノックス、3-[5-(4-クロロフェニル)-2,3-ジメチル

50

イソオキサゾリジン-3-イル]-ピリジン、2,3,5,6-テトラクロロ-4-メタンスルホニルピリジン、3,4,5-トリクロロピリジン-2,6-ジカルボニトリル、N-(1-(5-プロモ-3-クロロピリジン-2-イル)エチル)-2,4-ジクロロニコチンアミド、N-((5-プロモ-3-クロロピリジン-2-イル)メチル)-2,4-ジクロロニコチンアミド;

-ピリミジン:ブピリメート、シプロジニル、ジフルメトリム、フェナリモル、フェリムゾン、メパニピリム、ニトラピリン、ヌアリモール、ピリメタニル;

-ピロール:フルジオキサニル、フェンピクロニル;

-モルホリン:アルジモルフ、ドデモルフ、ドデモルフ酢酸塩、フェンプロピモルフ、トリデモルフ;

-ジカルボキシミド:フルオロイミド、イプロジオン、プロシミドン、ピンクロゾリン;

-その他:アシベンゾラル-S-メチル、アミスルプロム、アニラジン、プラストサイジン-S、カプタホール、キャプタン、キノメチオネート、ダゾメット、デバカルブ、ジクロメジン、ジフェンゾコート、ジフェンゾコートメチル硫酸塩、ファモキサドン、フェンアミドン、フェノキサニル、フェンプロピジン、ホルベット、オクチリノン、オキシロニック酸、ピペラリン、プロベナゾール、プロキナジド、ピロキロン、キノキシフェン、トリアゾキシド、トリシクラゾール、トリホリン、5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン、2-プトキシ-6-ヨード-3-プロピルクロメン-4-オン。

【0071】

カルバメート及びジチオカルバメート

-チオ-及びジチオカルバメート:フェルバム、マンコゼブ、マンネブ、メタム、メタスルホカルブ、メチラム、プロピネブ、チラム、ジネブ、ジラム;

-カルバメート:ジエトフェンカルブ、ベンチアパリカルブ、イプロバリカルブ、プロパモカルブ、プロパモカルブ塩酸塩、パリフェナル、(4-フルオロフェニル)N-(1-(1-(4-シアノフェニル)エタンスルホニル)ブタ-2-イル)カルバメート。

【0072】

他の殺菌剤

-グアニジン:ドジン、ドジン遊離塩基、グアザチン、グアザチン酢酸塩、イミノクタジン、イミノクタジン三酢酸塩、イミノクタジントリス(アルベシル酸塩);

-抗生物質:カスガマイシン、カスガマイシン塩酸塩水和物、ポリオキシシン、ストレプトマイシン、バリダマイシンA;

-ニトロフェニル誘導体:ピナパクリル、ジクロラン、ジノブトン、ジノカップ、ニトロタールイソプロピル、テクナゼン;

-有機金属化合物:トリフェニル錫塩(例えば、酢酸トリフェニル錫、塩化トリフェニル錫、水酸化トリフェニル錫);

-硫黄含有ヘテロシクリル化合物:イソプロチオラン、ジチアノン;

-有機リン系化合物:エジフェンホス、ホセチル、ホセチルアルミニウム、イプロベンホス、ピラゾホス、トルクロホスメチル;

-有機塩素系化合物:クロタロニル、ジクロフルアニド、ジクロロフェン、フルスルファミド、ヘキサクロロベンゼン、ペンシクロン、ペンタクロロフェノール及びその塩、フタリド、キントゼン、チオファネートメチル、トリルフルアニド、N-(4-クロロ-2-ニトロフェニル)-N-エチル-4-メチルベンゼンスルホンアミド;

-無機活性化合物:亜リン酸及びその塩、硫黄、ボルドー液、銅塩(例えば、酢酸銅、水酸化銅、オキシ塩化銅、塩基性硫酸銅);

-その他:ピフェニル、プロノポール、シフルフェナミド、シモキサニル、ジフェニルアミン、メトラフェノン、ミルジオマイシン、オキシシン銅、プロヘキサジオンカルシウム、スピロキサミン、トリルフルアニド、N-(シクロプロピルメトキシイミノ-(6-ジフルオロメトキシ-2,3-ジフルオロフェニル)メチル)-2-フェニルアセトアミド、N'-(4-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N'-(4-(4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)-2,5-ジメチルフェニル)

10

20

30

40

50

ル) -N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N'-(2-メチル-5-トリフルオロメチル-4-(3-トリメチルシラニルプロボキシ)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン、N'-(5-ジフルオロメチル-2-メチル-4-(3-トリメチルシラニルプロボキシ)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン。

【0073】

従って、本発明は更に表Bにリストされている組成物に関し、表Bの各行は好ましくは本明細書中に好ましいと記載されている化合物の1つである式Iを有する化合物(成分1)、及びその行にそれぞれ示されている追加の活性化化合物(成分2)を含む殺菌組成物に相当する。本発明の1つの実施形態によれば、表Bの各行の成分1はそれぞれ表1~54中において個々に明記されている式Iを有する化合物の1つである。

10

【表2】

表B

行	成分1	成分2
B-1	式Iの化合物	アゾキシストロビン
B-2	式Iの化合物	ジモキシストロビン
B-3	式Iの化合物	エネストロブリン
B-4	式Iの化合物	フルオキサストロビン
B-5	式Iの化合物	クレソキシムメチル
B-6	式Iの化合物	メトミノストロビン
B-7	式Iの化合物	オリザストロビン
B-8	式Iの化合物	ピコキシストロビン
B-9	式Iの化合物	ピラクロストロビン
B-10	式Iの化合物	ピリベンカルブ
B-11	式Iの化合物	トリフロキシストロビン
B-12	式Iの化合物	2-(2-(6-(3-クロロ-2-メチルフェノキシ)-5-フルオロピリミジン-4-イルオキシ)フェニル)-2-メトキシイミノ-N-メチルアセトアミド
B-13	式Iの化合物	2-(オルト-((2,5-ジチルフェニルオキシメチレン)フェニル)-3-メトキシアクリル酸メチルエステル
B-14	式Iの化合物	3-メトキシ-2-(2-(N-(4-メトキシフェニル)シクロプロパンカルボキシミドイルスルファニルメチル)フェニル)アクリル酸メチルエステル

20

30

行	成分1	成分2
B-15	式Iの化合物	ベナラキシル
B-16	式Iの化合物	ベナラキシル-M
B-17	式Iの化合物	ベノダニル
B-18	式Iの化合物	ビキサフェン
B-19	式Iの化合物	ボスカリド
B-20	式Iの化合物	カルボキシシ
B-21	式Iの化合物	フェンフラム
B-22	式Iの化合物	フェンヘキサミド
B-23	式Iの化合物	フルトラニル
B-24	式Iの化合物	フラメトピル
B-25	式Iの化合物	イソチアニル
B-26	式Iの化合物	キララキシル
B-27	式Iの化合物	メプロニル
B-28	式Iの化合物	メタラキシル
B-29	式Iの化合物	オフレース
B-30	式Iの化合物	オキサジキシル
B-31	式Iの化合物	オキシカルボキシシ
B-32	式Iの化合物	ペンチオピラド
B-33	式Iの化合物	チフルザミド
B-34	式Iの化合物	テクロフタラム
B-35	式Iの化合物	チアジニル
B-36	式Iの化合物	2-アミノ-4-メチルチアゾール-5-カルボキサニリド
B-37	式Iの化合物	2-クロロ-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)-ニコチンアミド
B-38	式Iの化合物	N-(3',4'-ジクロロ-5-フルオロピフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド
B-39	式Iの化合物	5-フルオロ-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸 [2-(1,3-ジメチルブチル)フェニル]アミド
B-40	式Iの化合物	N-(4'-クロロ-3',5-ジフルオロピフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド
B-41	式Iの化合物	N-(4'-クロロ-3',5-ジフルオロピフェニル-2-イル)-3-トリフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド
B-42	式Iの化合物	N-(3',4'-ジクロロ-5-フルオロピフェニル-2-イル)-3-トリフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド
B-43	式Iの化合物	N-(3',5-ジフルオロ-4'-メチルピフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド
B-44	式Iの化合物	N-(3',5-ジフルオロ-4'-メチルピフェニル-2-イル)-3-トリフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド
B-45	式Iの化合物	N-(2-ビスクロプロピル-2-イルフェニル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド
B-46	式Iの化合物	N-(シス-2-ビスクロプロピル-2-イルフェニル)-3-

10

20

30

40

行	成分1	成分2
		ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド
B-47	式Iの化合物	N-(トランス-2-ピシクロプロピル-2-イルフェニル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド
B-48	式Iの化合物	ジメトモルフ
B-49	式Iの化合物	フルモルフ
B-50	式Iの化合物	フルメトバー
B-51	式Iの化合物	フルオピコリド (ピコベンズアミド)
B-52	式Iの化合物	フルオピラム
B-53	式Iの化合物	ゾキサミド
B-54	式Iの化合物	N-(3-エチル-3, 5, 5-トリメチルシクロヘキシル)-3-ホルミルアミノ-2-ヒドロキシベンズアミド
B-55	式Iの化合物	カルプロパミド
B-56	式Iの化合物	ジクロシメット
B-57	式Iの化合物	マンジプロパミド
B-58	式Iの化合物	オキシテトラサイクリン
B-59	式Iの化合物	シルチオファム
B-60	式Iの化合物	N-(6-メトキシピリジン-3-イル)シクロプロパンカルボキサミド
B-61	式Iの化合物	アザコナゾール
B-62	式Iの化合物	ビテルタノール
B-63	式Iの化合物	ブロムコナゾール
B-64	式Iの化合物	シプロコナゾール
B-65	式Iの化合物	ジフェノコナゾール
B-66	式Iの化合物	ジニコナゾール
B-67	式Iの化合物	ジニコナゾール-M
B-68	式Iの化合物	エニルコナゾール
B-69	式Iの化合物	エポキシコナゾール
B-70	式Iの化合物	フェンブコナゾール
B-71	式Iの化合物	フルシラゾール
B-72	式Iの化合物	フルキンコナゾール
B-73	式Iの化合物	フルトリアホル
B-74	式Iの化合物	ヘキサコナゾール
B-75	式Iの化合物	イミベンコナゾール
B-76	式Iの化合物	イプコナゾール
B-77	式Iの化合物	メトコナゾール
B-78	式Iの化合物	ミクロブタニル
B-79	式Iの化合物	オキシポコナゾール
B-80	式Iの化合物	パクロブトラゾール
B-81	式Iの化合物	ベンコナゾール
B-82	式Iの化合物	プロピコナゾール
B-83	式Iの化合物	プロチオコナゾール
B-84	式Iの化合物	シメコナゾール
B-85	式Iの化合物	テブコナゾール
B-86	式Iの化合物	テトラコナゾール
B-87	式Iの化合物	トリアジメノール
B-88	式Iの化合物	トリアジメホン

10

20

30

40

行	成分1	成分2
B-89	式Iの化合物	トリチコナゾール
B-90	式Iの化合物	ウニコナゾール
B-91	式Iの化合物	1-(4-クロロフェニル)-2-([1, 2, 4]トリアゾル-1-イル)シクロヘプタノール
B-92	式Iの化合物	シアゾファミド
B-93	式Iの化合物	イマザリル
B-94	式Iの化合物	イマザリル硫酸塩
B-95	式Iの化合物	ペフラゾエート
B-96	式Iの化合物	プロクロラズ
B-97	式Iの化合物	トリフルミゾール
B-98	式Iの化合物	ベノミル
B-99	式Iの化合物	カルベンダジム
B-100	式Iの化合物	フベリダゾール
B-101	式Iの化合物	チアベンダゾール
B-102	式Iの化合物	エタボキサム
B-103	式Iの化合物	エトリジアゾール
B-104	式Iの化合物	ヒメキサゾール
B-105	式Iの化合物	フルアジナム
B-106	式Iの化合物	ピリフェノックス
B-107	式Iの化合物	1-(4-クロロフェニル)-1-(プロピン-2-イルオキシ)-3-(4-(3, 4-ジメトキシフェニル)イソオキサゾール-5-イル)プロパン-2-オン
B-108	式Iの化合物	3-[5-(4-クロロフェニル)-2, 3-ジメチルイソオキサゾリジン-3-イル]ピリジン
B-109	式Iの化合物	2, 3, 5, 6-テトラクロロ-4-メタンスルホニルピリジン
B-110	式Iの化合物	3, 4, 5-トリクロロピリジン-2, 6-ジカルボニトリル
B-111	式Iの化合物	N-(1-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)エチル)-2, 4-ジクロロニコチンアミド
B-112	式Iの化合物	N-(1-(5-ブロモ-3-クロロピリジン-2-イル)メチル)-2, 4-ジクロロニコチンアミド
B-113	式Iの化合物	プピリメート
B-114	式Iの化合物	シプロジニル
B-115	式Iの化合物	ジフルメトリム
B-116	式Iの化合物	フェリムゾン
B-117	式Iの化合物	フェナリモル
B-118	式Iの化合物	メバニピリム
B-119	式Iの化合物	ニトラピリン
B-120	式Iの化合物	ヌアリモール
B-121	式Iの化合物	ピリメタニル
B-122	式Iの化合物	フルジオキシニル
B-123	式Iの化合物	フェンピクロニル
B-124	式Iの化合物	アルジモルフ
B-125	式Iの化合物	ドデモルフ
B-126	式Iの化合物	ドデモルフ酢酸塩
B-127	式Iの化合物	フェンプロピモルフ
B-128	式Iの化合物	トリデモルフ
B-129	式Iの化合物	フルオロイミド

10

20

30

40

行	成分1	成分2
B-130	式Iの化合物	イプロジオン
B-131	式Iの化合物	プロシミドン
B-132	式Iの化合物	ピンクロゾリン
B-133	式Iの化合物	アシベンゾラル-S-メチル
B-134	式Iの化合物	アミスルプロム
B-135	式Iの化合物	アニラジン
B-136	式Iの化合物	ブラストサイジン-S
B-137	式Iの化合物	キャプタン
B-138	式Iの化合物	カプタホール
B-139	式Iの化合物	キノメチオネート
B-140	式Iの化合物	ダゾメット
B-141	式Iの化合物	デバカルブ
B-142	式Iの化合物	ジクロメジン
B-143	式Iの化合物	ジフェンゾコート
B-144	式Iの化合物	ジフェンゾコートメチル硫酸塩
B-145	式Iの化合物	ファモキサドン
B-146	式Iの化合物	フェンアミドン
B-147	式Iの化合物	フェノキサニル
B-148	式Iの化合物	フェンプロピジン
B-149	式Iの化合物	ホルベット
B-150	式Iの化合物	オクチリノン
B-151	式Iの化合物	オキシリニック酸
B-152	式Iの化合物	ピペラリン
B-153	式Iの化合物	プロベナゾール
B-154	式Iの化合物	プロキナジド
B-155	式Iの化合物	ピロキロン
B-156	式Iの化合物	キノキシフェン
B-157	式Iの化合物	トリアゾキシド
B-158	式Iの化合物	トリシクラゾール
B-159	式Iの化合物	トリホリン
B-160	式Iの化合物	5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-[1, 2, 4]トリアゾロ [1, 5-a]ピリミジン
B-161	式Iの化合物	2-プトキシ-6-ヨード-3-プロピルクロメン-4-オン
B-162	式Iの化合物	フェルバム
B-163	式Iの化合物	マンコゼブ
B-164	式Iの化合物	マンネブ
B-165	式Iの化合物	メチラム
B-166	式Iの化合物	メタム
B-167	式Iの化合物	メタスルホカルブ
B-168	式Iの化合物	プロピネブ
B-169	式Iの化合物	チラム
B-170	式Iの化合物	ジネブ
B-171	式Iの化合物	ジラム
B-172	式Iの化合物	ジエトフェンカルブ
B-173	式Iの化合物	フルベンチアバリカルブ
B-174	式Iの化合物	イプロバリカルブ
B-175	式Iの化合物	プロバモカルブ

10

20

30

40

行	成分1	成分2
B-176	式Iの化合物	プロパモカルプ塩酸塩
B-177	式Iの化合物	3-(4-クロロフェニル)-3-(2-イソプロポキシカルボニルアミノ-3-メチルブチリルアミノ)プロピオン酸メチルエステル
B-178	式Iの化合物	バリフェナル
B-179	式Iの化合物	N-(1-(1-(4-シアノフェニル)-エタンスルホニル)-ブタ-2-イル)カルバミン酸4-フルオロフェニル
B-180	式Iの化合物	ドジン
B-181	式Iの化合物	ドジン遊離塩基
B-182	式Iの化合物	イミノクタジン
B-183	式Iの化合物	イミノクタジン三酢酸塩
B-184	式Iの化合物	イミノクタジントリス(アルベシル酸塩)
B-185	式Iの化合物	グアザチン
B-186	式Iの化合物	グアザチン酢酸塩
B-187	式Iの化合物	カスガマイシン
B-188	式Iの化合物	カスガマイシン塩酸塩水和物
B-189	式Iの化合物	ポリオキシン
B-190	式Iの化合物	ストレプトマイシン
B-191	式Iの化合物	バリダマイシンA
B-192	式Iの化合物	ビナバクリル
B-193	式Iの化合物	ジクロラン
B-194	式Iの化合物	ジノプトン
B-195	式Iの化合物	ジノカップ
B-196	式Iの化合物	ニトロタールイソロピル
B-197	式Iの化合物	テクナゼン
B-198	式Iの化合物	酢酸トリフェニル錫
B-199	式Iの化合物	塩化トリフェニル錫
B-200	式Iの化合物	水酸化トリフェニル錫
B-201	式Iの化合物	イソプロチオラン
B-202	式Iの化合物	ジチアノン
B-203	式Iの化合物	エジフェンホス
B-204	式Iの化合物	ホセチル
B-205	式Iの化合物	ホセチルアルミニウム
B-206	式Iの化合物	イプロベンホス
B-207	式Iの化合物	ピラゾホス
B-208	式Iの化合物	トルクロホスメチル
B-209	式Iの化合物	クロロタロニル
B-210	式Iの化合物	ジクロフルアニド
B-211	式Iの化合物	ジクロロフェン
B-212	式Iの化合物	フルスルファミド
B-213	式Iの化合物	ヘキサクロロベンゼン
B-214	式Iの化合物	ペンシクロン
B-215	式Iの化合物	ペンタクロロフェノール及びその塩
B-216	式Iの化合物	フタリド
B-217	式Iの化合物	キントゼン
B-218	式Iの化合物	チオファネートメチル
B-219	式Iの化合物	トリルフルアニド
B-220	式Iの化合物	N-(4-クロロ-2-ニトロフェニル)-N-エチル-4-メチ

10

20

30

40

行	成分1	成分2
		ルベンゼンスルホンアミド
B-221	式Iの化合物	リン酸及びその塩
B-222	式Iの化合物	硫黄
B-223	式Iの化合物	ボルドー液
B-224	式Iの化合物	酢酸銅
B-225	式Iの化合物	水酸化銅
B-226	式Iの化合物	オキシ塩化銅
B-227	式Iの化合物	塩基性硫酸銅
B-228	式Iの化合物	ピフェニル
B-229	式Iの化合物	プロノポール
B-230	式Iの化合物	シフルフェナミド
B-231	式Iの化合物	シモキサニル
B-232	式Iの化合物	ジフェニルアミン
B-233	式Iの化合物	メトラフェノン
B-234	式Iの化合物	ミルジオマイシン
B-235	式Iの化合物	オキシ銅
B-236	式Iの化合物	プロヘキサジオンカルシウム
B-237	式Iの化合物	スピロキサミン
B-238	式Iの化合物	トリルフルアニド
B-239	式Iの化合物	N-(シクロプロピルメトキシイミノ-(6-ジフルオロメトキシ-2,3-ジフルオロフェニル)メチル)-2-フェニルアセトアミド
B-240	式Iの化合物	N ² -(4-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン
B-241	式Iの化合物	N ² -(4-(4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン
B-242	式Iの化合物	N ² -(2-メチル-5-トリフルオロメチル-4-(3-トリメチルシラニルプロポキシ)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン
B-243	式Iの化合物	N ² -(5-ジフルオロメチル-2-メチル-4-(3-トリメチルシラニルプロポキシ)フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン

10

20

30

40

50

【 0 0 7 4 】

成分2として上に特定されている活性化合物II、その製造及びその菌病原体に対する作用は広く知られている(<http://www.hclrss.demon.co.uk/index.html>を参照されたい)。これらは市販されている。IUPAC命名法での化合物、その製造及びその殺菌活性も公知である[欧州特許出願公開第226 917号、欧州特許出願公開第10 28 125号、欧州特許出願公開第10 35 122号、欧州特許出願公開第12 01 648号、国際公開第98/46608号、国際公開第99/24413号、国際公開第03/14103号、国際公開第03/053145号、国際公開第03/066609号、国際公開第04/049804号を参照されたい]。

【 0 0 7 5 】

合成例

a) 1-クロロ-2-(3-フルオロフェニル)-3-(2-クロロフェニル)プロパン-2-オールの合成

o-クロロベンジルクロリド(0.1ml,0.8ミリモル)を無水ジエチルエーテル(20ml)及びヨウ素中に含む溶液にマグネシウム削り屑(1.09g,44.8ミリモル)を添加した。発熱反応が始まったら、更にベンジルクロリド(7.10g,44.0ミリモル)を反応溶液に還流下で1滴ず

つ添加した。混合物を還流下で更に2時間攪拌した後、0℃まで冷却し、2-クロロ-1-(2-クロロフェニル)エタノン(3.87g, 22.4ミリモル)を無水トルエン(10ml)中に含む溶液を1滴ずつ添加した。次いで、混合物を室温で3時間攪拌し、再び0℃まで冷却し、水性塩化アンモニウム溶液(10ml)を添加した。水相を酢酸エチルで繰り返し抽出し、合わせた有機相を乾燥(硫酸ナトリウム)し、溶媒を留去させた。残渣(約8.6g)を更に精製することなく次反応ステップのために使用した。

【0076】

b) (Z)-1-[3-クロロ-1-(2-クロロフェニル)プロパ-1-エン-2-イル]-3-フルオロベンゼンの合成

0℃で、1,4-ジオキサン/THF(49ml, 10:1)中のステップa)からの第3級アルコール(8.6g, ~22.4ミリモル)に無水酢酸(2.6ml, 26.9ミリモル)及び濃硫酸(0.1ml, 1.9ミリモル)を順次添加した。混合物を室温まで加温し、18時間攪拌した。その後、混合物を再び0℃まで冷却し、ブライン(20ml)を添加し、混合物を水性NaOHを用いて中和した。酢酸エチルで抽出した後、有機相を合わせ、硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を除去した。カラムクロマトグラフィー(シリカゲル)により精製して、淡黄色油状物の形態の所望の生成物(1.70g, 2ステップを通して27%)を得た。

【0077】

$^1\text{H NMR}$ (300MHz, CDCl_3) 7.65-7.62(1H), 7.46-7.27(6H), 7.09-7.03(1H), 7.1(1H), 4.48(2H)。

【0078】

c) アンチ-2-(3-フルオロフェニル)-2-(クロロメチル)-3-(2-クロロフェニル)オキシランの合成

前ステップの反応生成物(1.60g, 6.0ミリモル)を酢酸(60ml)中に溶解し、無水マレイン酸(11.8g, 120.6ミリモル)及び H_2O_2 (水中50%, 3.4ml, 60.3ミリモル)を添加した。反応混合物を45℃で3日間攪拌した後、室温まで冷却し、チオ硫酸塩水溶液(10%)を添加した。水(20ml)で希釈した後、混合物をジクロロメタンで抽出し、合わせた有機相を飽和ブラインで洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、混合物を濾別し、溶媒を減圧下で除去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(シリカゲル, ヘキサン/酢酸エチル)により精製した。こうして、無色固体の形態のエポキシド(732mg, 41%)が得られた。

【0079】

$^1\text{H NMR}$ (300MHz, CDCl_3) 7.50-7.47(1H), 7.44-7.28(6H), 7.11-7.04(1H), 4.24(1H), 3.88(1H), 3.34(1H)。

【0080】

d) 1-[(アンチ)-2-(3-フルオロフェニル)-3-(2-クロロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル]-1H-1,2,4-トリアゾールの合成

室温で、c)からのエポキシド(732mg, 2.4ミリモル)を無水DMF(10ml)中に含む溶液に1,2,4-トリアゾール(347mg, 4.9ミリモル)及び水素化ナトリウム(216mg, 5.4ミリモル)を添加した。混合物を60℃で20時間加熱した後、75℃で更に4時間攪拌した。次いで、反応溶液を室温まで冷却し、酢酸エチルを添加し、混合物を飽和ブラインで洗浄した。有機相を分離し、硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を減圧下で除去した。このようにして得られた残渣をカラムクロマトグラフィー(シリカゲル, ヘキサン/酢酸エチル)により精製した。画分を合わせて、標記化合物を融点が164-166℃の無色固体(720mg, 89%)の形態で得た。

【0081】

$^1\text{H NMR}$ (300MHz, CDCl_3) 7.88(1H), 7.79(1H), 7.60-7.57(1H), 7.49-7.29(4H), 7.23-7.11(2H), 7.05-6.99(1H), 4.79(1H), 4.24(1H), 3.96(1H)。

【0082】

表2にリストされている式Iを有する化合物を同様に合成した。

10

20

30

40

【表 3】

表 2 :

化合物	置換基A	物性データ
2.1	4-クロロフェニル	98-100
2.2	3-クロロフェニル	7.93 (1H), 7.83 (1H), 7.49 (1H), 7.39-7.29 (4H), 7.17-6.98 (3H), 4.77 (1H), 4.16 (1H), 4.12 (1H)
2.3	4-フルオロフェニル	73-75
2.4	2-クロロフェニル	164-166

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2007/063213

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV: A01N43/653 C07D405/06		
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 practical, 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.
X	EP 0 421 125 A (BASF AG [DE]) 10 April 1991 (1991-04-10) cited in the application page 1, line 1 - line 18; example 251 page 27; example 251; table b page 31, lines 29-54 claims 1,2,6	1-8
X	EP 0 474 045 A (BASF AG [DE]) 11 March 1992 (1992-03-11) page 1, line 1 - line 54 page 11; examples 137-139 claims 1,2	1-8
	-/--	
<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:		
<p>*A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance</p> <p>*E* earlier document but published on or after the international filing date</p> <p>*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)</p> <p>*O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means</p> <p>*P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed</p>		<p>*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</p> <p>*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</p> <p>*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.</p> <p>*&* document member of the same patent family</p>
Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report	
17 März 2008	26/03/2008	
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Authorized officer Gradassi, Giulia	

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2007/063213

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 196 038 A (BASF AG [DE]) 1 October 1986 (1986-10-01) cited in the application claims 1,3-5 examples column 2, line 6 - line 35	1-8
X	EP 0 094 564 A (BASF AG [DE]) 23 November 1983 (1983-11-23) cited in the application claims 1,5-7 examples page 1, line 1 - page 2, line 30	1-8
X	EP 0 388 871 A (BASF AG [DE]) 26 September 1990 (1990-09-26) claim 1 examples page 2, line 1 - line 29	1-8

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2007/063213

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0421125	A	10-04-1991	AU 637820 B2	10-06-1993
			AU 6227590 A	14-03-1991
			CA 2024404 A1	10-03-1991
			HU 207642 B	28-05-1993
			JP 3026828 B2	27-03-2000
			JP 3169879 A	23-07-1991
			NZ 235192 A	26-05-1993
			US 5162357 A	10-11-1992
EP 0474045	A	11-03-1992	AT 129243 T	15-11-1995
			AU 637258 B2	20-05-1993
			AU 8368591 A	12-03-1992
			CA 2048974 A1	08-03-1992
			DE 4028392 A1	12-03-1992
			DK 474045 T3	05-02-1996
			ES 2079008 T3	01-01-1996
			GR 3018015 T3	29-02-1996
			HU 58466 A2	30-03-1992
			JP 3164608 B2	08-05-2001
			JP 4230680 A	19-08-1992
ZA 9107085 A	08-03-1993			
EP 0196038	A	01-10-1986	AU 586234 B2	06-07-1989
			AU 5555086 A	02-10-1986
			CA 1271764 A1	17-07-1990
			HU 41402 A2	28-04-1987
			IL 78175 A	31-10-1989
			JP 2048561 C	25-04-1996
			JP 7084463 B	13-09-1995
			JP 61246179 A	01-11-1986
			MX 9203406 A1	01-08-1992
			US 4906652 A	06-03-1990
EP 0094564	A	23-11-1983	AT 30026 T	15-10-1987
			AU 557154 B2	11-12-1986
			AU 1458883 A	17-11-1983
			DE 3373902 D1	05-11-1987
			ES 8402833 A1	16-05-1984
			IL 68433 A	29-04-1986
			NL 971020 I1	01-10-1997
			NZ 204222 A	21-02-1986
EP 0388871	A	26-09-1990	CA 2012596 A1	21-09-1990
			ES 2054128 T3	01-08-1994
			HU 53488 A2	28-11-1990
			JP 3027378 A	05-02-1991

INTERNATIONALER RESEARCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2007/063213

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES INV. A01N43/653 C07D405/06		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
B. RESEARCHIERTE 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.
X	EP 0 421 125 A (BASF AG [DE]) 10. April 1991 (1991-04-10) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Zeile 1 - Zeile 18; Beispiel 251 Seite 27; Beispiel 251; Tabelle b Seite 31, Zeilen 29-54 Ansprüche 1,2,6	1-8
X	EP 0 474 045 A (BASF AG [DE]) 11. März 1992 (1992-03-11) Seite 1, Zeile 1 - Zeile 54 Seite 11; Beispiele 137-139 Ansprüche 1,2	1-8
<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 *E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist *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) *O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht *P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden 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 *X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden *Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist *Z* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche 17. März 2008		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts 26/03/2008
Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax. (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter Gradassi, Giulia

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

 Internationales Aktenzeichen
 PCT/EP2007/063213

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	EP 0 196 038 A (BASF AG [DE]) 1. Oktober 1986 (1986-10-01) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1,3-5 Beispiele Spalte 2, Zeile 6 - Zeile 35	1-8
X	EP 0 094 564 A (BASF AG [DE]) 23. November 1983 (1983-11-23) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1,5-7 Beispiele Seite 1, Zeile 1 - Seite 2, Zeile 30	1-8
X	EP 0 388 871 A (BASF AG [DE]) 26. September 1990 (1990-09-26) Anspruch 1 Beispiele Seite 2, Zeile 1 - Zeile 29	1-8

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2007/063213

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0421125	A	10-04-1991	AU 637820 B2	10-06-1993
			AU 6227590 A	14-03-1991
			CA 2024404 A1	10-03-1991
			HU 207642 B	28-05-1993
			JP 3026828 B2	27-03-2000
			JP 3169879 A	23-07-1991
			NZ 235192 A	26-05-1993
			US 5162357 A	10-11-1992
EP 0474045	A	11-03-1992	AT 129243 T	15-11-1995
			AU 637258 B2	20-05-1993
			AU 8368591 A	12-03-1992
			CA 2048974 A1	08-03-1992
			DE 4028392 A1	12-03-1992
			DK 474045 T3	05-02-1996
			ES 2079008 T3	01-01-1996
			GR 3018015 T3	29-02-1996
			HU 58466 A2	30-03-1992
			JP 3164608 B2	08-05-2001
			JP 4230680 A	19-08-1992
ZA 9107085 A	08-03-1993			
EP 0196038	A	01-10-1986	AU 586234 B2	06-07-1989
			AU 5555086 A	02-10-1986
			CA 1271764 A1	17-07-1990
			HU 41402 A2	28-04-1987
			IL 78175 A	31-10-1989
			JP 2048561 C	25-04-1996
			JP 7084463 B	13-09-1995
			JP 61246179 A	01-11-1986
			MX 9203406 A1	01-08-1992
US 4906652 A	06-03-1990			
EP 0094564	A	23-11-1983	AT 30026 T	15-10-1987
			AU 557154 B2	11-12-1986
			AU 1458883 A	17-11-1983
			DE 3373902 D1	05-11-1987
			ES 8402833 A1	16-05-1984
			IL 68433 A	29-04-1986
			NL 971020 I1	01-10-1997
			NZ 204222 A	21-02-1986
EP 0388871	A	26-09-1990	CA 2012596 A1	21-09-1990
			ES 2054128 T3	01-08-1994
			HU 53488 A2	28-11-1990
			JP 3027378 A	05-02-1991

フロントページの続き

(81)指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), EP(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, 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, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW

(74)代理人 100122389

弁理士 新井 栄一

(72)発明者 レンナー, イェンス

ドイツ連邦共和国 6 7 0 9 8 バッド デュルクハイム, ロルベールヴェーク 2

(72)発明者 グローテ, トーマス

ドイツ連邦共和国 6 7 1 5 7 ヴァッヘンハイム, イム ヘーエンハウゼン 1 8

(72)発明者 ミュラー, ベルンド

ドイツ連邦共和国 6 7 2 2 7 フランケンタール, シュトッキンガー シュトラーセ 7

(72)発明者 ローマン, ヤン, クラース

ドイツ連邦共和国 6 7 0 6 3 ルートヴィヒスハーフェン, グレーフェナオシュトラーセ 2 0

(72)発明者 ウルムシュナイダー, サラ

ドイツ連邦共和国 6 7 0 9 8 バッド デュルクハイム, ロルベールヴェーク 2

(72)発明者 グレートリ, アリス

ドイツ連邦共和国 6 8 1 6 5 マンハイム, ソフィエンシュトラーセ 1 3アー

(72)発明者 ディーツ, ヨッヘン

ドイツ連邦共和国 6 8 1 6 7 マンハイム, シュペルツェンシュトラーセ 2アー

Fターム(参考) 4C063 AA01 BB03 CC71 DD41 EE03

4H011 AA01 BA01 BB09 BC05 BC06 BC07 BC20 DA02 DA14 DC05

DD03

【要約の続き】

るための式Iを有する化合物の使用及び前記化合物を含む組成物に関する。

【選択図】 なし