

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第4624557号
(P4624557)

(45) 発行日 平成23年2月2日(2011.2.2)

(24) 登録日 平成22年11月12日(2010.11.12)

(51) Int. Cl.		F I	
C O 7 D 207/34	(2006.01)	C O 7 D 207/34	C S P
C O 7 D 405/12	(2006.01)	C O 7 D 405/12	
C O 7 D 409/12	(2006.01)	C O 7 D 409/12	
C O 7 D 409/14	(2006.01)	C O 7 D 409/14	
A O 1 N 25/00	(2006.01)	A O 1 N 25/00	1 O 2

請求項の数 12 (全 30 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2000-564936 (P2000-564936)	(73) 特許権者	500584309
(86) (22) 出願日	平成11年8月10日 (1999.8.10)		シンジェンタ パーティシペーションズ
(65) 公表番号	特表2002-522526 (P2002-522526A)		アクチェンゲゼルシャフト
(43) 公表日	平成14年7月23日 (2002.7.23)		スイス国, ツェーハー 4058 パーゼ
(86) 国際出願番号	PCT/EP1999/005837		ル, シュバルツバルトアレー 215
(87) 国際公開番号	W02000/009482	(74) 代理人	100077517
(87) 国際公開日	平成12年2月24日 (2000.2.24)		弁理士 石田 敬
審査請求日	平成18年8月9日 (2006.8.9)	(74) 代理人	100092624
(31) 優先権主張番号	9817548.2		弁理士 鶴田 準一
(32) 優先日	平成10年8月12日 (1998.8.12)	(74) 代理人	100108903
(33) 優先権主張国	英国 (GB)		弁理士 中村 和広
		(74) 代理人	100082898
			弁理士 西山 雅也
		(74) 代理人	100081330
			弁理士 樋口 外治

最終頁に続く

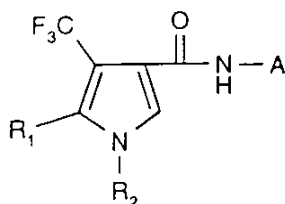
(54) 【発明の名称】 トリフルオロメチルピロールカルボキシアミド

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の式(1)：

【化1】



(1)

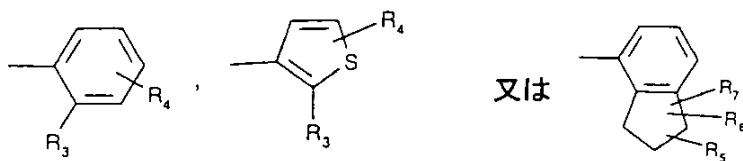
10

{ 式中、

R₁ は水素、ハロゲン、C₁₋₄ ハロアルキル又はC₁₋₄ アルキルであり、R₂ はC₁₋₄ アルキル、C₁₋₄ ハロアルキル、C₁₋₄ アルコキシ-C₁₋₄ アルキル、シアノ、C₁₋₄ アルキルスルホニル、フェニルスルホニル、ジ(C₁₋₄ アルキル)アミノスルホニル、C₁₋₆ アルキルカルボニル、ベンゾイル、又は置換フェニルスルホニル又はベンゾイルであり、そして

20

A は以下の基：
【化 2】



10

(基中、 R_3 は C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} ハロアルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニルオキシ、 C_{2-6} ハロアルケニルオキシ、 C_{2-6} アルキニルオキシ、 C_{3-7} シクロアルキル、 C_{1-4} アルキル - C_{3-7} シクロアルキル、 C_{4-7} シクロアルケニル、 C_{1-4} アルキル - C_{4-7} シクロアルケニル、 C_{3-7} シクロアルキルオキシ、 C_{1-4} アルキル - C_{3-7} シクロアルキルオキシ、 C_{5-7} シクロアルケニルオキシ、 C_{1-4} アルキル - C_{5-7} シクロアルケニルオキシ、フェニル、ナフチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、又は置換フェニル又はフェノキシ(ここで、上記置換基はハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルチオ、シアノ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 C_{1-4} アルキルカルボニル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} ハロアルコキシ、メチレンジオキシ若しくはジフルオロメチレンジオキシ、又はフェニルから独立して選ばれる 1 ~ 3 の基である。)であり；

20

R_4 は水素、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} アルコキシ又は C_{1-4} ハロアルコキシであり；そして

R_5 、 R_6 、及び R_7 は互いに独立して C_{1-6} アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル又は C_{3-7} シクロアルキル - C_{1-4} アルキルである。)である。}により表されるトリフルオロオメチルピロールカルボキサミド。

【請求項 2】

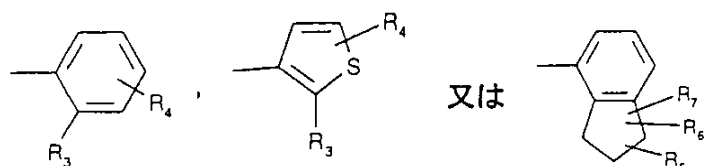
式中、

R_1 が水素又は C_{1-4} アルキルであり、

R_2 が C_{1-4} アルキルであり、そして

A が以下の基：

【化 3】



40

(基中、 R_3 は C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} ハロアルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニルオキシ、 C_{2-6} ハロアルケニルオキシ、 C_{2-6} アルキニルオキシ、 C_{3-7} シクロアルキル、 C_{1-4} アルキル - C_{3-7} シクロアルキル、 C_{4-7} シクロアルケニル、 C_{1-4} アルキル - C_{4-7} シクロアルケニル、 C_{3-7} シクロアルキルオキシ、 C_{1-4} アルキル - C_{3-7} シクロアルキルオキシ、 C_{5-7} シクロアルケニルオキシ、 C_{1-4} アルキル - C_{5-7} シクロアルケニルオキシ、フェニル、ナフチル、フェニルであってハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C

50

C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルチオ、シアノ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 C_{1-4} アルキルカルボニル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} ハロアルコキシ、メチレンジオキシ若しくはジフルオロメチレンジオキシ、又はフェニルから独立して選ばれた 1 ~ 3 の基により置換されたものであり；

R_4 は水素、ハロゲン又は C_{1-4} アルキルであり；そして

R_5 、 R_6 、及び R_7 は互いに独立して C_{1-6} アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル又は C_{3-7} シクロアルキル - C_{1-4} アルキルである。) である、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 3】

式中、 R_1 が水素又はメチルである、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

10

【請求項 4】

式中、 R_2 がメチルである、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 5】

式中、 R_3 がフェニル又はフェニルであってハロゲンにより置換されたものである、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 6】

式中、 R_1 が水素又はメチルであり、 R_2 がメチルであり、そして R_3 がフェニル又はフェニルであってハロゲンにより置換されたものである、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 7】

20

N - (2 - ビフェニルイル) - 1 - メチル - 4 - トリフルオロメチルピロール - 3 - カルボキシアミド、

N - (4' - クロロ - 2 - ビフェニルイル) - 4 - トリフルオロメチルピロール - 3 - カルボキシアミド、

N - (4' - フルオロ - 2 - ビフェニルイル) - 4 - トリフルオロメチルピロール - 3 - カルボキシアミド、

N - { 2 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - チエニル } - 4 - トリフルオロメチルピロール - 3 - カルボキシアミド、

N - { 2 - (4 - クロロフェニル) - 3 - チエニル } - 4 - トリフルオロメチルピロール - 3 - カルボキシアミド、

30

N - (3', 4' - ジフルオロ - 2 - ビフェニルイル) - 4 - トリフルオロメチルピロール - 3 - カルボキシアミド、

N - (3' - トリフルオロメチル - 2 - ビフェニルイル) - 4 - トリフルオロメチルピロール - 3 - カルボキシアミド、及び

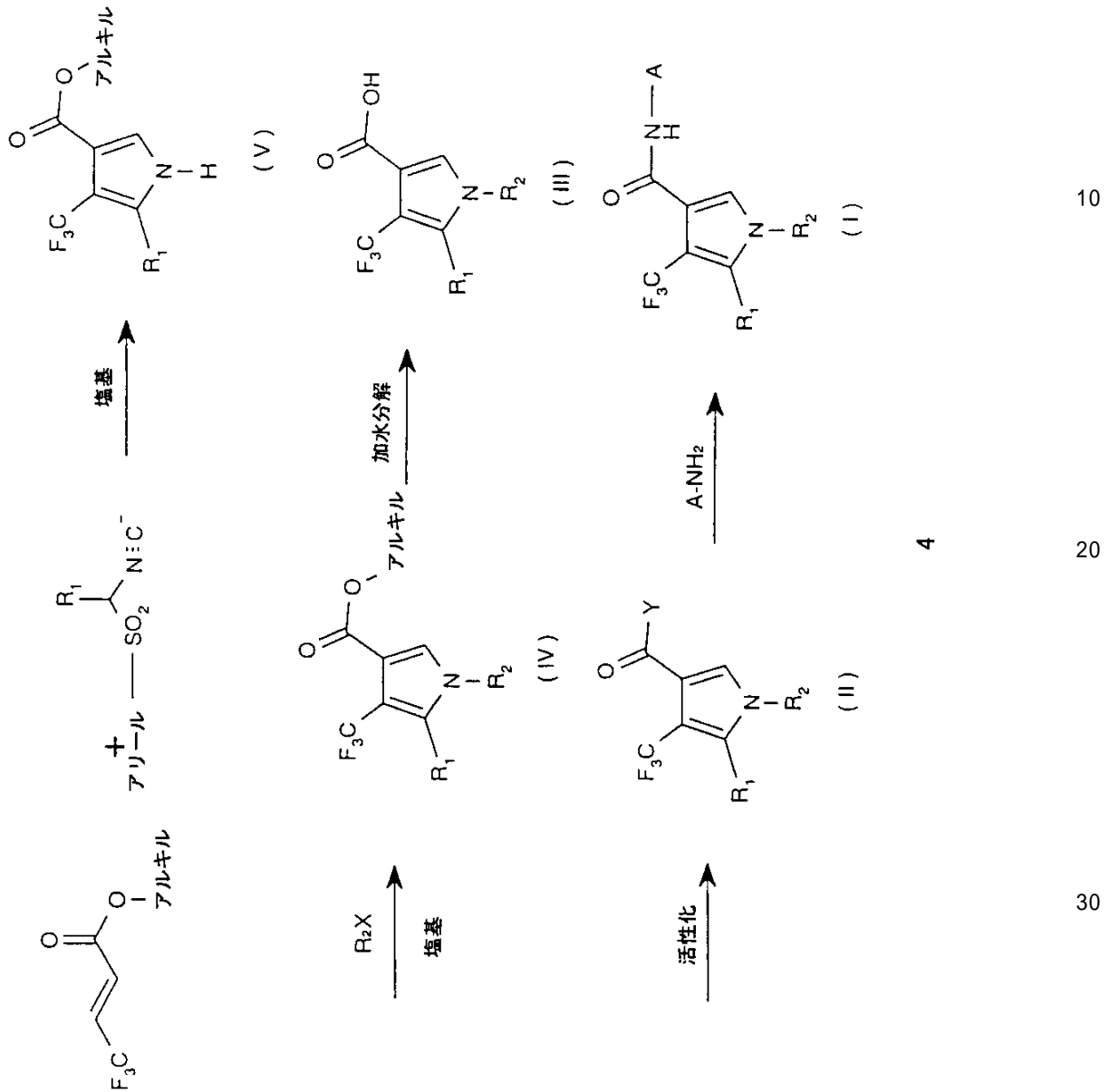
N - (4' - クロロ - 3' - フルオロ - 2 - ビフェニルイル) - 4 - トリフルオロメチルピロール - 3 - カルボキシアミド、

を含む群から選ばれる、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

以下のスキーム：

【化4】



{スキーム中、A、 R_1 、及び R_2 は請求項1において式(I)のために定めたものと同じであり、XとYは脱離基であり、アルキルは低級アルキル成分を表し、そしてアリールはフェニル又はトリルを表す。}に従って上記出発材料を反応させることを含む、請求項1に記載の式(I)の化合物の製法。

【請求項9】

以下のスキーム：

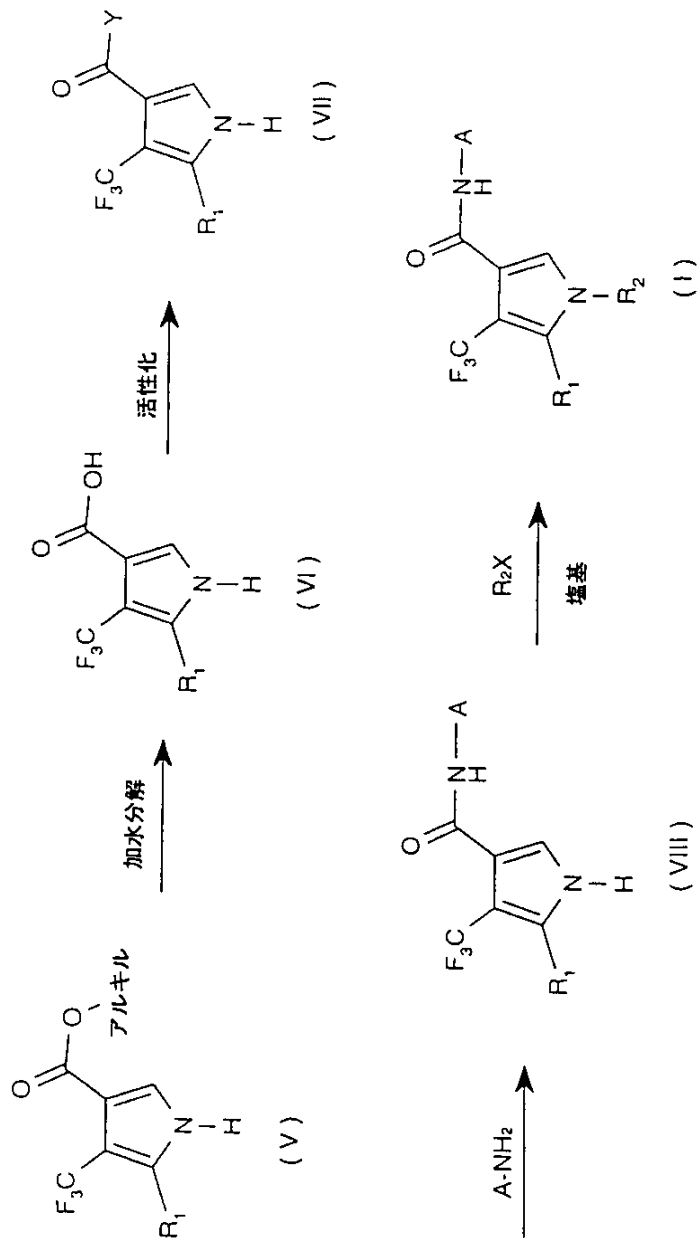
10

20

30

40

【化5】



5

10

20

30

{スキーム中、 A 、 R_1 、及び R_2 は請求項1において式(I)のために定めたものと同じであり、 X と Y は脱離基であり、そしてアルキルは低級アルキル成分を表し、場合により、上記アミド化ステップの間に保護基を使用する。}に従って上記出発材料を反応させることを含む、請求項1に記載の式(I)の化合物の製法。

40

【請求項10】

微生物をコントロールし、そしてそれによる植物の攻撃(attack)及び侵襲(infestation)を予防するための組成物であって、その活性成分が、好適な担体とともにある請求項1に記載の化合物である、前記組成物。

【請求項11】

植物病原性微生物による侵襲に対して植物を保護するための、請求項1に記載の式(I)の化合物の使用。

【請求項12】

50

植物、その部分又はその場に、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物の適用による植物病原性微生物による栽培植物の侵襲のコントロール又は予防方法。

【発明の詳細な説明】

【0001】

本発明は、微生物活性、特に殺菌活性を有する新規トリフルオロメチルピロールカルボキシアミド (trifluoromethyl pyrrole carboxamides) に関する。本発明は、上記物質の製造、活性成分として上記新規化合物の中の少なくとも 1 を含む農業組成物、上記組成物の製造、並びに植物病原性微生物、好ましくは真菌 (fungi) による植物の侵襲をコントロールし又は予防するための農業及び園芸における上記活性成分又は組成物の使用にも関する。

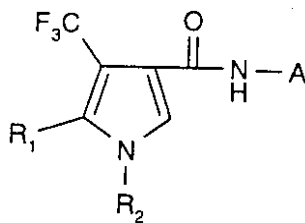
10

【0002】

本発明のトリフルオロメチルピロールカルボキシアミドは、以下の一般式 (I) :

【0003】

【化 6】



(I)

20

【0004】

{ 式中、

R₁ は水素、ハロゲン、C₁₋₄ ハロアルキル又は C₁₋₄ アルキルであり、

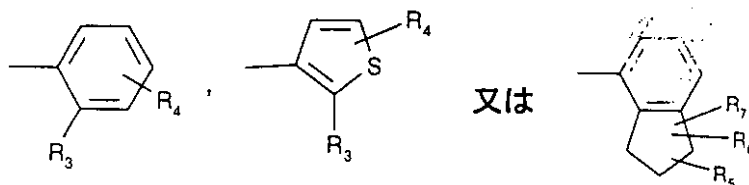
R₂ は C₁₋₄ アルキル、C₁₋₄ ハロアルキル、C₁₋₄ アルコキシ - C₁₋₄ アルキル、シアノ、C₁₋₄ アルキルスルホニル、フェニルスルホニル、ジ (C₁₋₄ アルキル) アミノスルホニル、C₁₋₆ アルキルカルボニル、ベンゾイル、又は置換フェニルスルホニル又はベンゾイルであり、そして

30

A は以下の基 :

【0005】

【化 7】



40

【0006】

(基中、R₃ は C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ ハロアルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ ハロアルケニル、C₂₋₆ アルキニル、C₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₆ ハロアルコキシ、C₂₋₆ アルケニルオキシ、C₂₋₆ ハロアルケニルオキシ、C₂₋₆ アルキニルオキシ、C₃₋₇ シクロアルキル、C₁₋₄ アルキル - C₃₋₇ シクロアルキル、C₄₋₇ シクロアルケニル、C₁₋₄ アルキル - C₄₋₇ シクロアルケニル、C₃₋₇ シクロアルキルオキシ、C₁₋₄ アルキル - C₃₋₇ シクロアルキルオキシ、C₅₋₇ シクロアルケニルオキシ、C₁₋₄ アルキル - C₅₋₇ シクロアルケニルオキシ、フェニル、ナフチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、又は置換フェニル

50

又はフェノキシ(ここで、上記置換基はハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルチオ、シアノ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 C_{1-4} アルキルカルボニル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} ハロアルコキシ、メチレンジオキシ若しくはジフルオロメチレンジオキシ、又はフェニルから独立して選ばれる1~3の基である。)であり;

R_4 は水素、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} アルコキシ又は C_{1-4} ハロアルコキシであり;そして

R_5 、 R_6 、及び R_7 は互いに独立して C_{1-6} アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル又は C_{3-7} シクロアルキル- C_{1-4} アルキルである。)である。}をもつ。

【0007】

農芸の実務において有用な殺菌特性を有するニコチン酸アミドはEP-A-0545099から知られている。実地目的のための上記開示化合物は、常に、最近の農芸の必要性を満たすわけではない。

驚くべきことに、今般、式(I)の化合物が、農業及び園芸における実用のためにそれらをより好適なものにするところの改良された生物学的特性を示すことが発見された。

【0008】

不斎炭素原子が式(I)の化合物内に存在する場合、これらの化合物は光学活性形にある。本発明は、純粋な異性体、例えば、エナンチオマー及びジアステレオマー、並びに可能な異性体混合物の全て、例えば、ジアステレオマーの混合物、ラセミ体、又はラセミ体混合物に関する。

本明細書中、アルキルは、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、*n*-ペンチル、イソ-ペンチル、*sec*-ペンチル、*tert*-ペンチル、及び*neo*-ペンチルを表す。非分枝アルキルが好ましい。他の基、例えば、アルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキル、アルキルシクロアルキル、アルキルシクロアルコキシ、アルキルカルボニル、アルキルスルホニル、アルキルアミノ等の一部としてのアルキルは同様に理解される。ハロゲンは一般に、フルオロ、クロロ、プロモ又はヨードを意味すると理解されるであろう。フルオロ、クロロ又はプロモが好ましい意味である。他の基、例えば、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルケニル、ハロアルケニルオキシ又はハロフェニル等の一部としてのハロゲンは同様に理解される。置換フェニルスルホニル及びベンゾイルの置換基は、モノ-~5回で存在することができ、そして好ましくは、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルチオ、シアノ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 C_{1-4} アルキルカルボニル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} ハロアルコキシ、メチレンジオキシ若しくはジフルオロメチレンジオキシ、又はフェニルから独立して選ばれる。フェニル、フェニルスルホニル、フェノキシ、及びベンゾイルの一部としてのフェニル基が置換される場合、このような基は、例えば、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2,4-ジクロロフェニル、3,4-ジクロロフェニル、3,5-ジクロロフェニル、2,4-ジフルオロフェニル、3,4-ジフルオロフェニル、3,5-ジフルオロフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、2-トリフルオロメトキシフェニル、3-トリフルオロメトキシフェニル、4-トリフルオロメトキシフェニル、4-メチルフェニル、4-エチルフェニル、4-イソプロピルフェニル、4-*tert*-ブチルフェニル、3,4-ジメチルフェニル、2,4,6-トリメチルフェニル、3-クロロ-4-フルオロフェニル、4-クロロ-3-フルオロフェニル、4-ビフェニル、3-ビフェニル、その他を指す。

【0009】

活性成分の特別なサブグループは、式(I)の化合物であって、式中、

R_1 が水素又は C_{1-4} アルキルであり、

R_2 が C_{1-4} アルキルであり、そして

Aが以下の基:

【0010】

10

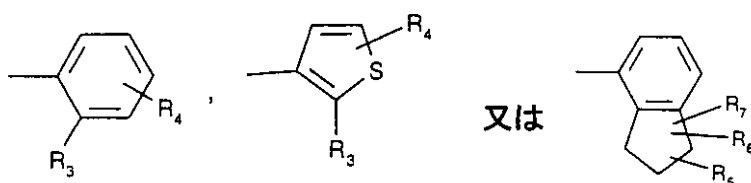
20

30

40

50

【化 8】



又は

10

【0011】

(基中、 R_3 は C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} ハロアルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニルオキシ、 C_{2-6} ハロアルケニルオキシ、 C_{2-6} アルキニルオキシ、 C_{3-7} シクロアルキル、 C_{1-4} アルキル - C_{3-7} シクロアルキル、 C_{4-7} シクロアルケニル、 C_{1-4} アルキル - C_{4-7} シクロアルケニル、 C_{3-7} シクロアルキルオキシ、 C_{1-4} アルキル - C_{3-7} シクロアルキルオキシ、 C_{5-7} シクロアルケニルオキシ、 C_{1-4} アルキル - C_{5-7} シクロアルケニルオキシ、フェニル、ナフチル、フェニルであってハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルチオ、シアノ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 C_{1-4} アルキルカルボニル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} ハロアルコキシ、メチレンジオキシ若しくはジフルオロメチレンジオキシ、又はフェニルから独立して選ばれた 1 ~ 3 の基により置換されたものであり；

R_4 は水素、ハロゲン、又は C_{1-4} アルキルであり；そして

R_5 、 R_6 、及び R_7 は互いに独立して C_{1-6} アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル又は C_{3-7} シクロアルキル - C_{1-4} アルキルである。) であるものにより表される。

20

【0012】

式 (I) の化合物群中、式中、a) R_1 が水素又はメチルであり、又は

b) R_2 がメチルであり、又は

c) R_3 がフェニル又はフェニルであってハロゲンにより置換されたものであるような化合物が好ましい。

30

他の好ましいサブグループは、式中、 R_1 が水素又はメチルであり、 R_2 がメチルであり、そして R_3 がフェニル又はフェニルであってハロゲンにより置換されたものである化合物により構成される。

【0013】

好ましい個々の化合物は：

N - (2 - ビフェニルイル) - 1 - メチル - 4 - トリフルオロメチルピロール - 3 - カルボキサミド、

N - (4' - クロロ - 2 - ビフェニルイル) - 4 - トリフルオロメチルピロール - 3 - カルボキサミド、

N - (4' - フルオロ - 2 - ビフェニルイル) - 4 - トリフルオロメチルピロール - 3 - カルボキサミド、

40

N - (2 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - チエニル) - 4 - トリフルオロメチルピロール - 3 - カルボキサミド、

N - (2 - (4 - クロロフェニル) - 3 - チエニル) - 4 - トリフルオロメチルピロール - 3 - カルボキサミド、

N - (3', 4' - ジフルオロ - 2 - ビフェニルイル) - 4 - トリフルオロメチルピロール - 3 - カルボキサミド、

N - (3' - トリフルオロメチル - 2 - ビフェニルイル) - 4 - トリフルオロメチルピロール - 3 - カルボキサミド、及び

N - (4' - クロロ - 3' - フルオロ - 2 - ビフェニルイル) - 4 - トリフルオロメチル

50

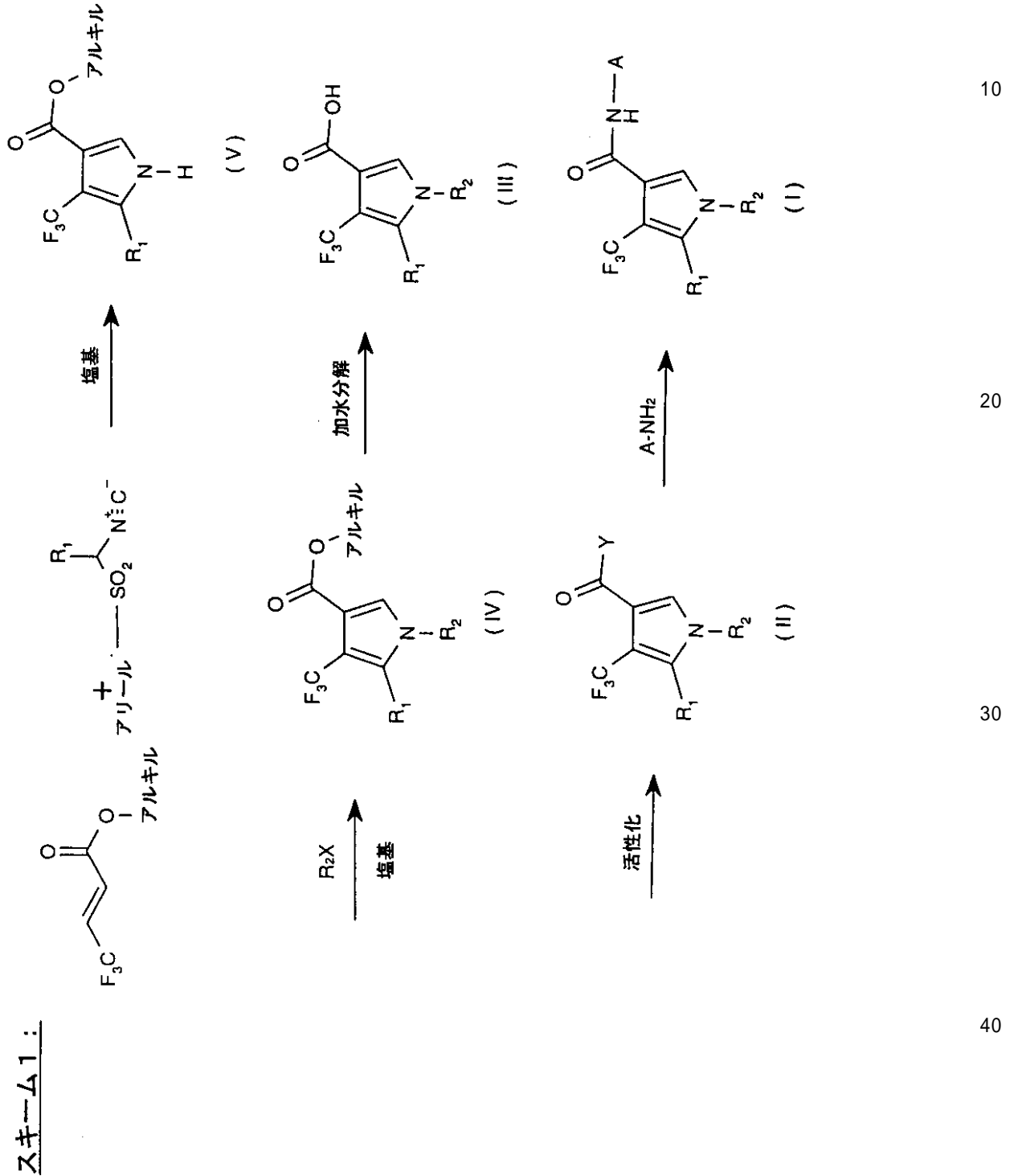
ピロール - 3 - カルボキシアミド、
である。

【 0 0 1 4 】

式 (I) の化合物は、以下の反応スキームに従って製造されることができる。

【 0 0 1 5 】

【 化 9 】



【 0 0 1 6 】

{ スキーム中、A、 R_1 、及び R_2 は式 (I) のために定めたものと同じであり、XとYは脱離基であり、アルキルは低級アルキル成分を表し、そしてアリールはフェニル又はトリルを表す。 }

上記脱離基XとYは好ましくはハロゲン原子を表すが、混合無水物の成分、例えば、 - O

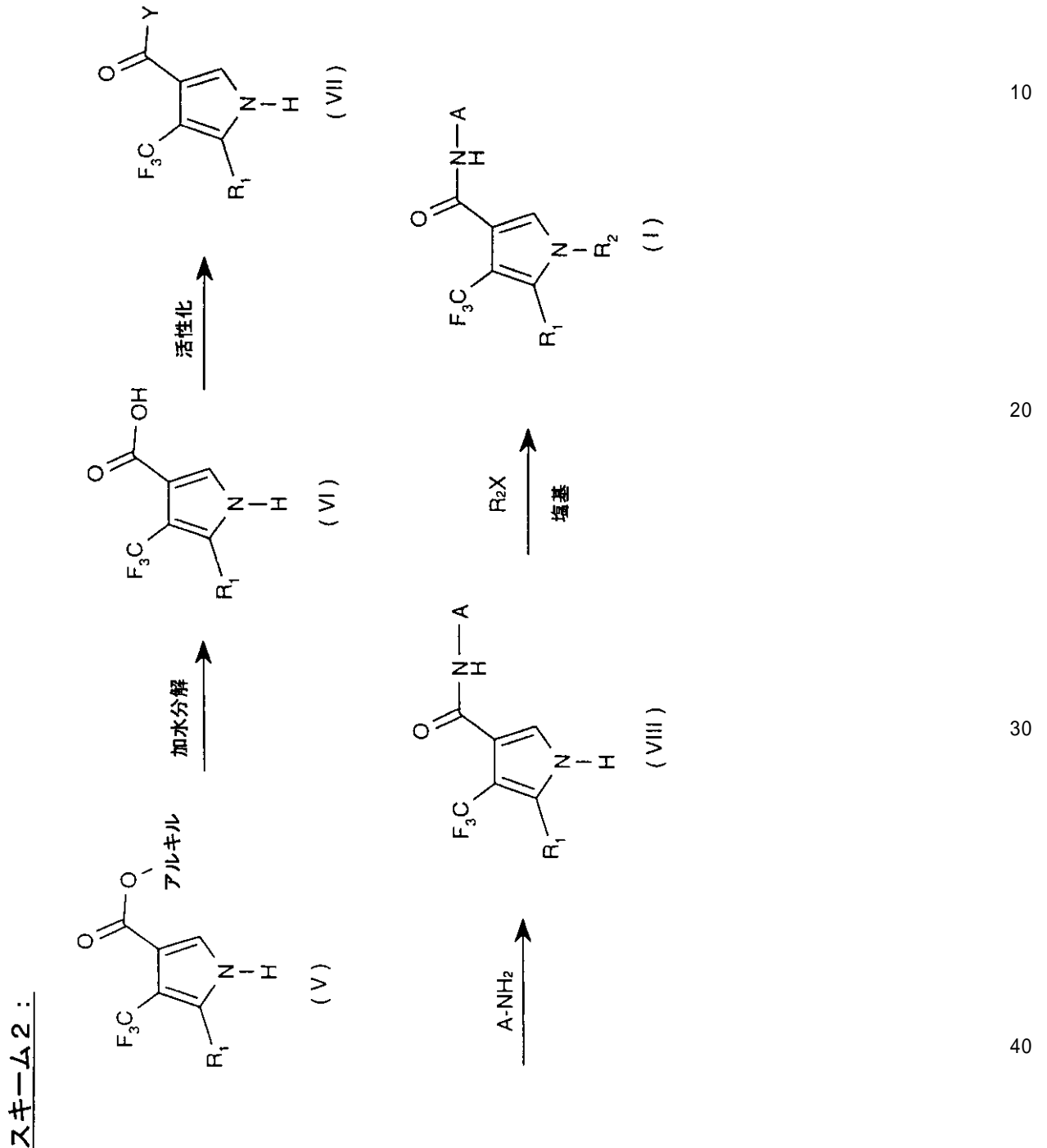
-CO-アルキル、-O-PO(アルキル)₂-O-C(=N-アルキル)トリアゾール
イル、その他を表すこともできる。

【0017】

あるいは、基R₂とAの導入は、スキーム2に従って異なる順序であることができる。

【0018】

【化10】



【0019】

{スキーム中、A、R₁、及びR₂はスキーム1のために定めたものと同じである。}
置換パターンの特別な場合においては、3位のカルボニル官能基におけるアミド化反応の間の副反応を避けるために、ピロール環の1-位において保護基を使用することが好ましい。好適な保護基はベンジルその他である。また、保護基の導入及び解裂は、一般的なベンジル化反応及び加水分解反応により行われる。

【0020】

式(I)の新規カルボキシアミドは、好ましくは、式(II)の活性化されたカルボン酸を芳香族アミンと反応させることにより得られる。脱離基Yに依存して、その反応は酸結合性剤の存在下で行われる。不活性溶媒が好ましくは使用されるが、Schotten-Baumann条件といわれる水性溶媒混合物も使用されうる。

【0021】

活性化は、対応の塩化アシル(Y = 塩素)を得るために、上記ピロール・カルボン酸(III)を活性化剤、例えば、酸ハライド、例えば、塩化チオニル又は塩化オキザリルと反応させることにより、又は上記文献中に知られた他の一般的なカップリング活性化方法により、達成される。

式(III)のカルボン酸は、標準的な加水分解条件を使用した加水分解により、対応のエステルから製造されることができ。

【0022】

式(IV)のN-アルキル化ピロール・カルボン酸エステルを得るための式(V)のピロール・カルボン酸エステルのN-アルキル化は、標準的な条件を使用して、式(V)のピロール・カルボン酸エステルを、アルキル化剤、例えば、ジアルキルスルフェート、アルキル・ハロゲン化物又はアルキルスルホネートと反応させることにより達成されることができ。式(V)のピロール・カルボン酸エステルは、典型的には、van Leusenプロトコル、すなわち、塩基の存在下でのアリール・スルホニル・イソシアニドとのアルキル・アクリレートとの反応、に従って製造されることができ。スキームIにおいて使用される典型的な塩基は、金属ヒドリド、金属アルコレート、及び金属ヒドロキシドを含む。上記反応条件下で不活性である。溶媒が使用されうる。代表的な溶媒は、エーテル(ジエチルエーテル、ジメトキシエタン、THFその他)、極性非プロトン溶媒、例えば、DMSO、DMF、DMA、又はプロトン溶媒、例えば、アルコールを含む。このような溶媒の混合物も使用されうる。多くの場合、自然には2相反応系を要求する、相転移反応条件が利用可能である。好ましくは、スキームIの反応順序の全体が、単一容器反応として行われる。

【0023】

驚ろくべきことに、今般、式(I)の新規化合物が、実用目的をもって、真菌並びにバクテリア及びウイルスにより引き起こされる病気に対して植物を保護するための、ひじょうに有利な活性スペクトルをもつことが発見された。

式(I)の化合物は、植物害虫の防除のための活性成分として農業部門及び関連分野において使用されることができ。本新規化合物は、低適用率における優れた活性、良好な植物耐性、及び環境安全性により顕著である。それらは、ひじょうに有用な、治療的、予防的、及び全身(浸透)特性を有し、そして多数の栽培植物の保護のために使用されることができ。式(I)の化合物を使用して、有用植物のさまざまな作物の植物又は植物の部分(果実、花、葉、茎、塊茎、根)の上に現れる害虫を抑制又は破壊することができ、そして同時に、その後成長する植物の部分を、例えば、植物病原性微生物からすることもできる。

【0024】

式(I)の化合物は、真菌感染に対して保護するために、そして土壌中に現れる植物病原性真菌に対して保護するために、特に種子(果実、塊茎、穀粒)のための及び植物の切り枝(例えば、米)の植物の増殖性材料の処理のためのドレッシングとして使用されることもできる。

式(I)の化合物は、例えば、以下の綱に属する植物病原性真菌：不完全菌綱(例えば、ドトリティス(Botrytis)、ピリキュラリア(Pyricularia)、ヘルミンソスポリウム(Helminthosporium)、フザリウム(Fusarium)、セプトリア(Septoria)、セルコスポラ(Cercospora)、及びオルターナリア(Alternaria)及び担子菌綱(例えば、リゾクトニア(Rhizoctonia)、ヘミレイア(Hemileia)、プキニア(Puccinia

10

20

30

40

50

)) に対して有効である。さらに、それらは、子囊菌綱 (例えば、ベンチュリア (*Venturia*) 及びエリシフェ (*Erysiphe*)、ポドスファエラ (*Podosphaera*)、モニリニア (*Monilinia*)、ウンシニユラ (*Uncinula*)) 及び卵菌綱 (例えば、フィトフトーラ (*Phytophthora*)、ピシウム (*Pythium*)、プラスモパラ (*Plasmopara*)) に対しても有効である。顕著な活性がウドンコビヨウキン (powdery mildew) (*Erysiphe* spp.) に対して観察されている。さらに、式 (I) の新規化合物は、植物病原性バクテリア及びウイルスに対して (例えば、キサントモナス種 (*Xanthomonas* spp.)、シュードモナス種 (*Pseudomonas* spp.)、イルウィニア・アミロポーラ (*Erwinia amylovora*) 並びにタバコ・モザイク・ウイルスに対して) 有効である。

10

【0025】

本発明の範囲内で、保護されるべき標的作物は、典型的には、以下の植物種を含む；穀物 (小麦、大麦、ライ、オーツ、米、メイズ、モロコシ、及び関連穀物)；ビート (サトウダイコン及び飼料ビート)；ナシ状果、石果及び小果樹 (リンゴ、ナシ、プラム、桃、アーモンド、さくらんぼ、いちご、ラズベリー及びブラック・ベリー)；マメ科植物 (インゲン豆、レンズ豆、エンドウ豆、大豆)；油植物 (アブラナ、からし、ケシ、オリーブ、ヒマワリ、ココナッツ、ヒマシ油植物、ココア豆、アメリカホドイモ)；ウリ科植物 (カボチャ、キュウリ、メロン)；繊維植物 (綿、フラックス、アサ、ジュート)；柑キツ類果実 (オレンジ、レモン、グレープフルーツ、マンダリン)；野菜 (ハウレンソウ、レタス、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、玉ねぎ、トマト、ポテト、パプリカ)；クスノキ科 (アボカド、シナモン、ショウノウ)；及びタバコ、ナッツ、コーヒー、ナス、サトウキビ、茶、コショウ、つる植物、ホップ、バナナ植物、及び天然ゴム植物の如き植物、並びに観賞植物。

20

【0026】

化合物 (I) は、非修飾形態で、又は好ましくは、配合技術において慣用されるアジュバントとともに使用される。このために、それらは、知られたやり方で、例えば、乳化性濃縮物、被覆可能ペースト、直接スプレーできる又は希釈できる溶液、希釈されたエマルジョン、水和性粉末、可溶性粉末、粉剤又は粒剤に、例えば、ポリマー物質内への封入により、便利に加工される。組成物のタイプと同様に、適用方法、例えば、スプレー、霧化 (atomizing) 散布 (dusting)、散乱 (scattering)、コーティング (coating) 又は注ぎ (pouring) が、意図された目的及び普及状況に従って、選択される。上記組成物は、特別な効果を達成するために、さらなるアジュバント、例えば、安定剤、消泡剤、粘度調節剤、結合剤又は粘着剤、並びに肥料微量栄養素供与体又は他の配合物を含有することもできる。

30

【0027】

好適な担体及びアジュバントは固体又は液体であることができ、そして配合技術において適当な物質、例えば、天然又は再生鉱物物質、溶媒、分散体、湿潤剤、粘着剤、増粘剤、結合剤又は肥料である。このような担体は、例えば、WO 97 / 33890 中に記載されている。

40

式 (I) の化合物は、通常、組成物の形で使用され、そしてさらなる化合物と同時に又は順番に、処理されるべき作物の領域又は植物に適用されることができる。これらのさらなる化合物は、例えば、肥料、微量栄養素供与体又は他の調製物であって植物の成長に影響を及ぼすものであることができる。それらは、選択的な除草剤、並びに殺虫剤、殺菌剤、殺バクテリア剤、殺線虫剤、殺陸貝剤又は上記調製物のいくつかの混合物であり、所望により配合分野において慣用されるさらなる担体、界面活性剤又は適用促進アジュバントとともにある。

【0028】

式 (I) の化合物は、他の殺菌剤と混合され、ある場合には、予想外のシナジー効果をもたらすことができる。

50

特に好ましい混合成分は：アゾール、例えば、アザコナゾール (azaconazole)、ピタータノール (bitertanol)、プロピコナゾール (propiconazole)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、ジニコナゾール (diniconazole)、シプロコナゾール (cyproconazole)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フルシラゾール (flusilazole)、フルトリアフォル (flutriafol)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、イマザリル (imazalil)、イミベンコナゾール (imibenconazole)、イブコナゾール (ipconazole)、テブコナゾール (tebuconazole)、テトラコナゾール (tetraconazole)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、メトコナゾール (metconazole)、ミクロブタニル (myclobutanil)、ペフラゾエート (pefurazoate)、ペンコナゾール (penconazole)、ブロムコナゾール (bromuconazole)、ピリフェノックス (pyrifenoxy)、プロクロラズ (prochloraz)、トリアジメフォン (triadimefon)、トリアジメノール (triadimenol)、トリフルミゾール (triflumizole) 又はトリティコナゾール (triticonazole)；ピリミジニル・カルピノール、例えば、アンシミドール (ancymidol)、フェナリモール (fenarimol) 又はヌアリモール (nuarimol)；2 - アミノ - ピリミジン、例えば、ブピリメート (bupirimate)、ジメチリモール (dimethirimol) 又はエチリモール (ethirimol)；モリフォリン、例えば、ドデモルフ (dodemorph)、フェンプロピジン (fenpropidin)、フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、スピロキサミン (spiroxamin) 又はトリデモルフ (tridemorph)；アニリノピリミジン、例えば、シプロジニル (cyprodinil)、ピリメタニル (pyrimethanil) 又はメパニピリン (mepanipyrim)；ピロール、例えば、フェンピクロニル (fenpiclonil) 又はフルジオキサニル (fludioxonil)；フェニルアミド、例えば、ベナラキシル (benalaxyl)、フララキシル (furalaxyl)、メタラキシル (metalaxyl)、R - メタラキシル (R-metalaxyl)、オフレース (ofurace) 又はオキサジキシル (oxadixyl)；ベンズイミダゾール、例えば、ベノミル (benomyl)、カルベンダジン (carbendazim)、デバカーブ (debacarb)、フベリダゾール (uberidazole) 又はチアベンダゾール (thiabendazole)；ジカルボキシイミド、例えば、クロゾリネート (chlozolinate)、ジクロゾリン (dichlozoline)、イプロジオン (iprodisone)、ミクロゾリン (myclozoline)、プロシミドン (procymidone) 又はピンクロゾリン (vinclozolin)；カルボキシアミド、例えば、カルボキシン (carboxin)、フェンフラム (fenfuram)、フルトラニル (flutolanil)、メプロニル (meppronil)、オキシカルボキシン (oxycarboxin) 又はチフルザミド (thifluzamide)；グアニジン、例えば、グアザチン (guazatine)、ドジン (dodine) 又はイミノクタジン (iminooctadine)；ストロビルリン、例えば、アゾキシストロビン (azoxystrobin)、クレゾキシム - メチル (kresoxime-methyl)、メトミノストロビン (metominostrobin)、SSF - 129、メチル 2 - [(2 - トリフルオロメチル) - ピリド - 6 - イルオキシメチル] - 3 - メトキシアクリレート又は (2 - [(2 - [(2 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) イミノ] - オキシ] - O - トリル) - グリオキシル酸メチルエステル - O - メチルオキシム (トリフロキシストロビン)；ジチオカーバメート、例えば、ファーバム (ferbam)、マンコゼブ (mancozeb)、マネブ (maneb)、メチラム (metiram)、プロピネブ (propineb)、チラム (thiram)、ジネブ (zineb) 又はジラム (ziram)；N - ハロメチルチオ - ジカルボアミド、例えば、キャプタフォル (captanfol)

10

20

30

40

50

)、キャプタン (captan)、ジクロフルアニド (dichlofluanid)、
 フルオロミド (fluoromide)、フォルペット (folpet) 又はトリフルア
 ニド (tolylfluanid); Cu 化合物、例えば、ボルドー (Bordeaux)
 混合物、水酸化銅、銅オキシクロリド、硫酸銅、酸化第 1 銅、マンカパー (mancop
 per) 又はオキシシ - カパー (oxine - copper); ニトロフェノール誘導体
 、例えば、ジノキャップ (dinocap) 又はニトロタール - イソプロピル; 有機 - P
 誘導体、例えば、エディフェンフォス (edifenphos)、イプロベンフォス (i
 probenphos)、イソプロチオラン (isoprothiolane)、フォス
 ジフェン (phosdiphen)、ピラゾフォス (pyrazophos) 又はトルク
 ロフォス - メチル (tolclofos - methyl); その他の多枝にわたる構造を
 もつ化合物、例えば、アシベンゾラー - S - メチル (acibenzolar - S - m
 ethyl)、アニラジン (anilazine)、ブラステシジン - S (blast
 icidin - S)、チノメチオナット (chinomethionat)、クロロネブ
 (chloroneb)、クロロタロニル (chlorothalonil)、シモキサ
 ニル (cymoxanil)、ジクロラン (dichlone)、ジクロメジン (dic
 lomezine)、ジクロラン (dicloran)、ジエトフェンカーブ (diet
 hofencarb)、ジメトモルフ (dimethomorph)、ジチアノン (di
 thianon)、エトリジアゾール (etridiazole)、ファモキサドン (f
 amoxadone)、フェナミドン (fenamidon)、フェンチン (fenti
 n)、フェリムゾン (ferimzone)、フルアジナム (fluazinam)、フ
 ルスルファミド (flusulfamide)、フェンヘキサミド (fenhexami
 d)、フォセチル - アルミニウム (fosetyl - aluminium)、ヒメキサゾ
 ール (hymexazol)、カスガマイシン (kasugamycin)、メタスルホ
 カーブ (methasulfocarb)、ペンシキュロン (pencycuron)、
 フタリド (phthalide)、ポリオキシシ (polyoxins)、プロベナゾ
 ール (probenazole)、プロパモカーブ (propamocarb)、ピロキノ
 ン (pyroquilon)、キノキシフェン (quinoxifen)、キントゼン (q
 uintozene)、硫黄、トリアゾキシド、トリシクラゾール、トリフォリン (t
 riforine)、バリダマイシン (validamycin)、(S) - 5 - メチル
 - 2 - メチルチオ - 5 - フェニル - 3 - フェニル - アミノ - 3, 5 - ジヒドロイミダゾ
 ール - 4 - オン (RPA 407213)、3, 5 - ジクロロ - N - (3 - クロロ - 1 - エ
 チル - 1 - メチル - 2 - オキソプロピル) - 4 - メチルベンズアミド (RH - 7281)
 、N - アリル - 4, 5 - ジメチル - 2 - トリメチルシリルチオフエン - 3 - カルボキシア
 ミド (MON 65500)、4 - クロロ - 4 - シアノ - N, N - ジメチル - 5 - p - ト
 リリイミダゾール - 1 - スルホン - アミド (IKF - 916)、N - (1 - シアノ - 1,
 2 - ジメチル - プロピル) - 2 - (2, 4 - ジクロロフェノキシ) - プロピオンアミド (A
 C 382042)、又はイプロバリカーブ (iprovalicarb) (SZX7
 22) である。

【0029】

式 (I) の化合物又はこれらの化合物の少なくとも 1 を含有する農芸化学組成物の好まし
 い適用方法は、葉への適用である。適用の頻度及び割合は、対応の病原体による侵襲の危
 険に依存する。しかしながら、式 (I) の化合物は、植物の場を液体調製物に浸し、又は
 固体の形で、例えば、粒形態で土壌に上記化合物を適用することにより、土壌を介して根
 を通して (全身 (浸透) 作用) 植物に浸透することもできる (土壌適用)。水田栽培に際
 しては、粒剤が水をはった水田に計量されることができる。式 (I) の化合物は、上記殺
 菌剤の液体調製物中に穀粒又は塊茎を浸し、又は固体調製物でそれらを被覆することによ
 り種子に適用されることもできる (コーティング)。

【0030】

上記配合物、すなわち、式 (I) の化合物、及び所望により固体又は液体アジュバントを
 含有する組成物は、知られたやり方で、典型的には上記化合物を、増量剤、例えば、溶媒

10

20

30

40

50

、固体担体、そして場合により界面活性化合物（界面活性剤）とじかに混合し、そして／又はそれとともに粉碎することにより、製造されることができる。

【0031】

農薬組成物は、通常、0.1～99重量%の、特に0.1～95重量%の式(I)の化合物、99.1～1重量%の、特に99.8～5重量%の固体又は液体アジュバント、そして0～25重量%の、特に0.1～25重量%の界面活性剤を含有する。

有利な適用割合は、通常、1ヘクタール(ha)当り5g～2kgの活性物質(active ingredient(a.i.))、好ましくは、10g～1kg a.i./ha、最も好ましくは20g～600g a.i./haにある。種子浸漬剤として使用されるとき、便利な施用量は、10mg～1gの活性物質/kg種子である。

10

【0032】

濃縮物として商業的な製品を配合することが好ましいけれども、エンド・ユーザーは、通常、希釈配合品を使用する。

以下の非限定的実施例は、上述の発明をより詳細に説明する。温度は摂氏で与える。以下の略号を使用する：

m.p. = 融点；b.p. = 沸点。“NMR”は核磁気共鳴スペクトルを意味する。MSはマススペクトルを表す。“%”は重量パーセントである。但し、対応の濃度は他の単位で示す。

【0033】

製造実施例：

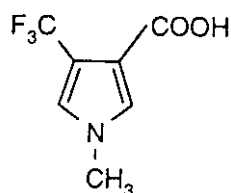
20

実施例 P 1：N-(2-ピフェニルイル)-1-メチル-4-トリフルオロメチルピロール-3-カルボキシアミド

a) 1-メチル-4-トリフルオロメチルピロール-3-カルボン酸

【0034】

【化11】



30

【0035】

ナトリウム・ヒドリド(8.0gの、油中75%分散体)を、DMSO(300ml)とジエチルエーテル(100ml)の混合物中に、+5で懸濁させる。DMSO(100ml)中のエチル4,4,4-トリフルオロクロトネート(20g)とTOSMIC(23g)の溶液を、その温度が10を超えないような速度で滴下漏斗を通して添加する。室温でさらに1時間上記反応混合物を攪拌した後、ヨウ化メチル(15.6ml)を冷却しながら添加する。室温で2時間後、上記反応混合物をクラッシュ・アイス上に注ぐ。エーテルによる反復抽出、ブラインによる併合有機相の洗浄、及び減圧下での上記溶媒の蒸発は、明るいコハク色の油の形で生成物混合物を与える。この粗生成物混合物を、エタノール(100ml)と水酸化ナトリウム(50ml)の、30%水溶液)の混合物中60に加熱する。エーテルによる上記溶液の洗浄、濃塩酸による上記水相の酸性化、及び濾過は、結晶性固体の形で、1-メチル-4-トリフルオロメチルピロール-3-カルボン酸を与える。

40

【0036】

¹H-NMR(CDC1₃): 7.24(d, H); 6.88(d, 1H); 3.63(s, 3H)。

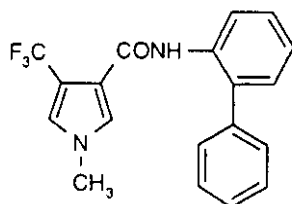
b) N-(2-ピフェニルイル)-1-メチル-4-トリフルオロメチルピロール-3-

50

カルボキシアミド

【0037】

【化12】



10

【0038】

塩化メチレン(20ml)中の1-メチル-4-トリフルオロメチルピロール-3-カルボン酸(1.9g)と塩化オキザリル(0.9ml)の溶液を、触媒量のDMFの存在下、室温で撹拌する。上記溶媒を減圧下で蒸発させて、結晶性固体を得る。この固体を塩化メチレン(10ml)中に溶解させ、そして0℃で塩化メチレン(20ml)中の2-ビフェニルアミン(1.7g)とトリエチルアミン(4.2ml)の溶液に添加する。この反応混合物を2時間室温で撹拌する。減圧下での上記溶媒の蒸発、水の添加、及び濾過が、N-(2-ビフェニル)-1-メチル-4-トリフルオロメチルピロール-3-カルボキシアミドを与える。

20

【0039】

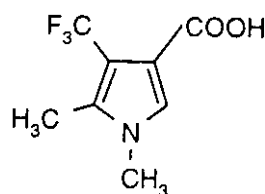
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.37 (d, 1H) ; 7.60 (s, br, 1H) ; 7.48 - 7.14 (m, 8H) ; 7.03 (d, 1H) ; 6.88 (d, 1H) ; 3.63 (s, 3H)。

実施例 P 2 : N-(2-ビフェニル)-1,5-ジメチル-4-トリフルオロメチルピロール-3-カルボキシアミド

a) 1,5-ジメチル-4-トリフルオロメチルピロール-3-カルボン酸

【0040】

【化13】



30

【0041】

塩化メチレン(100ml)及び水性水酸化ナトリウム(30mlの50%溶液)中、TOSMIC(20g)、ヨウ化メチル(18.5g)、及びN-ベンジル・トリエチルアンモニウム・クロライド(1g)の混合物を、3時間5℃で撹拌する。塩化メチレン(50ml)中のエチル4,4,4-トリフルオロクロトネート(20g)の溶液を、その温度が25℃を超えない速度で滴下漏斗を通して添加する。室温でさらに1時間上記反応混合物を撹拌した後、ヨウ化メチルを冷却しながら添加する。室温で2時間後、上記反応混合物をクラッシュ・アイス上に注ぐ。エーテルによる反復抽出、ブラインによる併合有機相の洗浄、及び上記溶媒の蒸発は、粗生成物混合物を与える。この純粋な中間体を、シリカゲル上のクロマトグラフィー後に得る。加水分解を実施例1a)下に述べた条件下で達成して、無色の結晶性固体に形で、1,5-ジメチル-4-トリフルオロメチルピロール-3-カルボン酸を得る。

40

【0042】

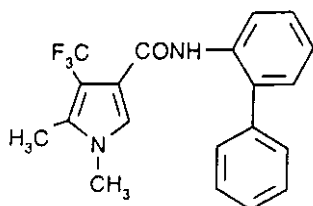
50

^1H -NMR (d_6 -DMSO) : 12.04 (s, br, 1H) ; 7.50 (s, 1H) ; 3.58 (s, 3H) ; 2.27 (s, 3H)。

b) N-(2-ビフェニルイル)-1,5-ジメチル-4-トリフルオロメチルピロール-3-カルボキシアミド

【0043】

【化14】



10

【0044】

塩化メチレン(20ml)中の1,5-ジメチル-4-トリフルオロメチルピロール-3-カルボン酸(1.9g)と塩化オキザリル(0.9ml)の溶液を、触媒量のDMFの存在下、室温で撹拌する。上記溶媒を減圧下で蒸発させて結晶性固体を得る。この固体を塩化メチレン(10ml)中に溶解させ、そして0 で塩化メチレン(20ml)中2-ビフェニルアミン(1.7g)とトリエチルアミン(4.2ml)の溶液に添加する。反応混合物を2時間室温で撹拌する。減圧下での上記溶媒の蒸発、水の添加、及び濾過が、N-(2-ビフェニルイル)-1,5-ジメチル-4-トリフルオロメチルピロール-3-カルボキシアミドを与える。

20

【0045】

^1H -NMR (CDCl_3) : 8.39 (d, 1H) ; 7.58 (s, br, 1H) ; 7.48 - 7.14 (m, 9H) ; 3.58 (s, 3H) ; 2.27 (s, 3H)。

以下の化合物を類似の方法を用いて、同様に製造する。

表1 : 式中、 R_1 が水素であり、 R_2 がメチルであり、そしてAが表A中の1行に対応する、式(I)の化合物。

【0046】

表2 : 式中、 R_1 と R_2 がメチルであり、そしてAが表A中の1行に対応する、式(I)の化合物。

30

表3 : 式中、 R_1 が水素であり、 R_2 がエチルであり、そしてAが表A中の1行に対応する、式(I)の化合物。

表4 : 式中、 R_1 が水素であり、 R_2 がメトキシメチルであり、そしてAが表A中の1行に対応する、式(I)の化合物。

【0047】

表5 : 式中、 R_1 が水素であり、 R_2 がシアノであり、そしてAが表A中の1行に対応する、式(I)の化合物。

表6 : 式中、 R_1 が水素であり、 R_2 がメチルスルホニルであり、そしてAが表A中の1行に対応する、式(I)の化合物。

40

表7 : 式中、 R_1 が水素であり、 R_2 がフェニルスルホニルであり、そしてAが表A中の1行に対応する、式(I)の化合物。

【0048】

表8 : 式中、 R_1 が水素であり、 R_2 がアセチルであり、そしてAが表A中の1行に対応する、式(I)の化合物。

表9 : 式中、 R_1 が水素であり、 R_2 がメトキシアセチルであり、そしてAが表A中の1行に対応する、式(I)の化合物。

表10 : 式中、 R_1 が水素であり、 R_2 がベンゾイルであり、そしてAが表A中の1行に対応する、式(I)の化合物。

50

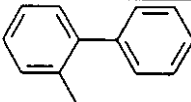
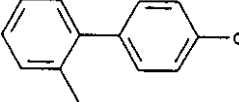
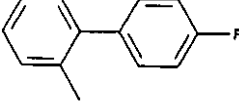
【 0 0 4 9 】

表 1 1 : 式中、 R_1 が水素であり、 R_2 が 4 - フルオロベンゾイルであり、そして A が表 A 中の 1 行に対応する、式 (I) の化合物。

【 0 0 5 0 】

【 表 1 】

表 A :

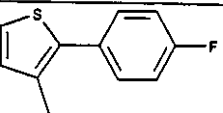
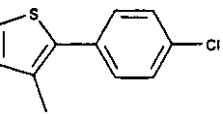
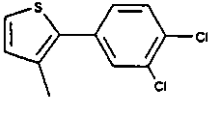
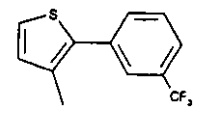
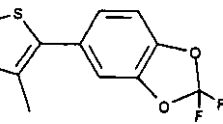
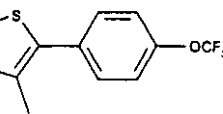
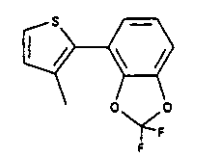
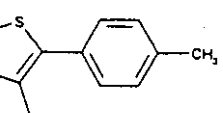
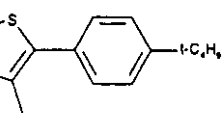
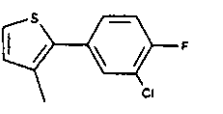
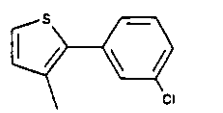
化合物番号	A
01	
02	
03	

10

20

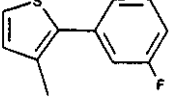
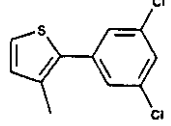
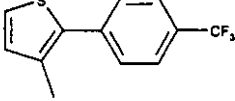
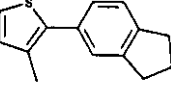
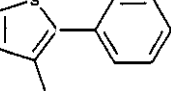
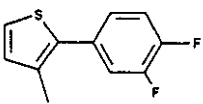
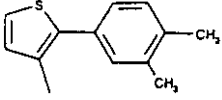
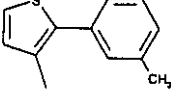
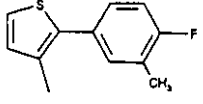
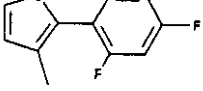
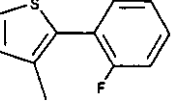
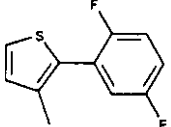
【 0 0 5 1 】

【 表 2 】

04		10
05		20
06		30
07		40
08		
09		
10		
11		
12		
13		
14		

【 0 0 5 2 】

【 表 3 】

15	
16	
17	
18	
19	
20	
21	
22	
23	
24	
25	
26	

10

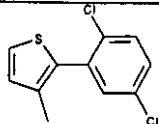
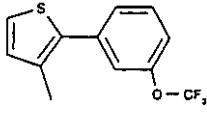
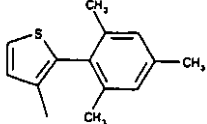
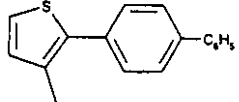
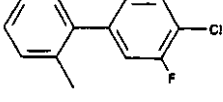
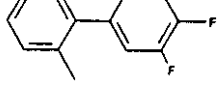
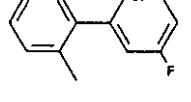
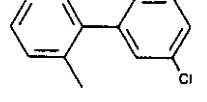
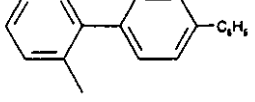
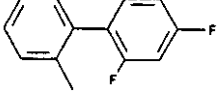
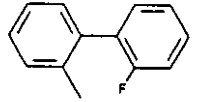
20

30

40

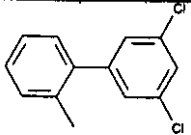
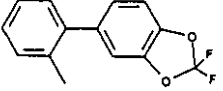
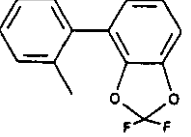
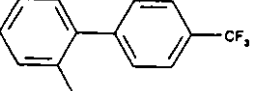
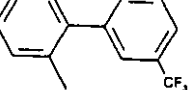
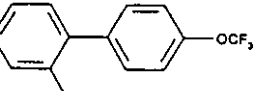
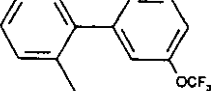
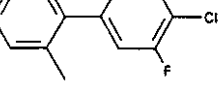
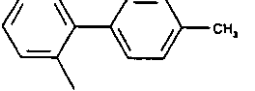
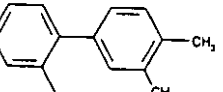
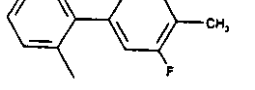
【 0 0 5 3 】

【 表 4 】

27		
28		
29		10
30		
31		
32		20
33		
34		
35		30
36		
37		

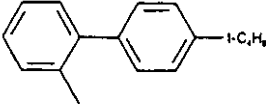
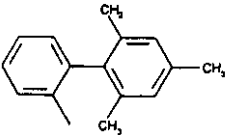
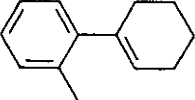
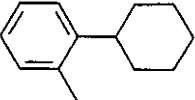
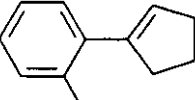
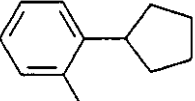
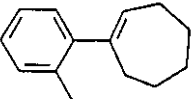
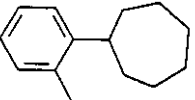
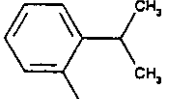
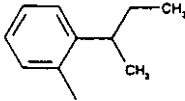
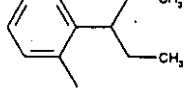
【 0 0 5 4 】

【 表 5 】

38		
39		
40		10
41		
42		
43		20
44		
45		
46		30
47		
48		

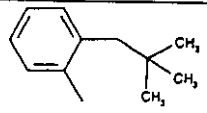
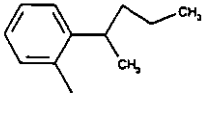
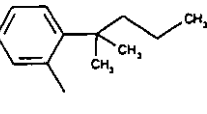
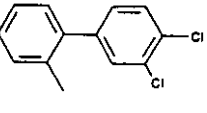
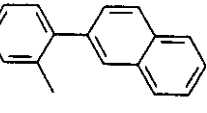
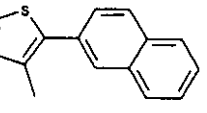
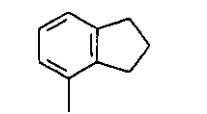
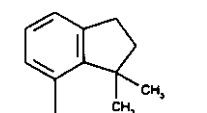
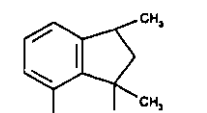
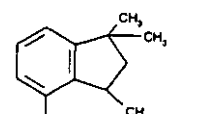
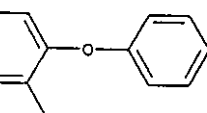
【 0 0 5 5 】

【 表 6 】

49		10
50		20
51		30
52		40
53		
54		
55		
56		
57		
58		
59		

【 0 0 5 6 】

【 表 7 】

60	
61	
62	
63	
64	
65	
66	
67	
68	
69	
70	

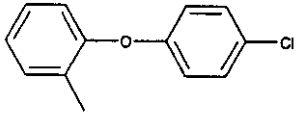
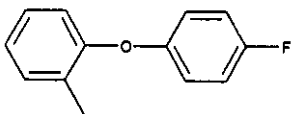
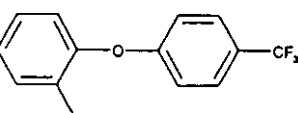
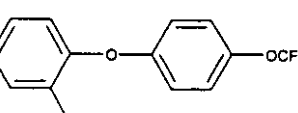
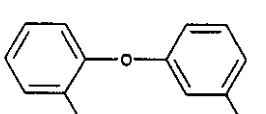
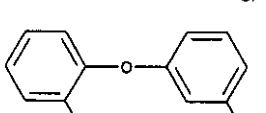
10

20

30

【 0 0 5 7 】
【 表 8 】

40

71		
72		
73		10
74		
75		20
76		

【 0 0 5 8 】

【 表 9 】

表 1 2 先の表 1 ~ 1 1 の選ばれた化合物についての物理-化学データ

化合物番号	物理-化学データ
	融点 [°C] 又は ¹ H-NMR (CDCl ₃)
1.01	8.37(d,1H); 7.60(s,br,1H); 7.48-7.14(m,8H); 7.03(s,1H); 6.88(s,1H); 3.63 (s,3H); 融点 00-102.
1.02	8.27(d,1H); 7.50(s,br,1H); 7.46-7.18(m,7H); 7.10(d,1H); 6.88(s,1H); 3.63(s,3H).
1.03	8.30(d,1H); 7.52(s,br,1H); 7.44-7.12(m,8H); 6.88(s,1H); 3.63(s,3H); 融点 151-153.

【 0 0 5 9 】

【 表 1 0 】

1.04	7.85(d,1H); 7.74(s,br,1H); 7.44(dd, 2H); 7.30(s,1H); 7.28(s,1H); 7.13(dd,2H); 6.93(s,1H); 3.68(s,3H); 融点 127-129.	
1.05	7.84(d,1H); 7.74(s,br,1H); 7.49(s,4H); 7.30(d,1H); 7,28(d,1H); 6.96(d,1H); 3.68(s,3H); 融点 142-145.	
1.30	7.89(d,1H); 7.76-7.25(m,12H); 6.95(s,1H); 3.69(s,3H); m.p. 168-169.	
1.35	融点 160-161.	
1.38	8.25(d,1H); 7.50(s,br,1H); 7.45-7.08(m,7H); 6.68(s,1H); 3,65(s,3H); 樹脂	10
1.40	融点 122-123.	
1.42	融点 142-143.	
1.71	融点 63-65.	
1.72	融点 112-114.	
1.76	樹脂	
2.02	融点 163-165.	
2.03	樹脂	
2.05	樹脂	
2.35	融点 124-125.	20
2.71	樹脂	
3.01	樹脂	
3.02	樹脂	
3.03	樹脂	
3.71	樹脂	
4.02	樹脂	
4.03	樹脂	
4.71	樹脂	
5.02	樹脂	30
5.03	樹脂	
5.71	樹脂	
8.02	樹脂	
8.03	樹脂	
8.04	樹脂	
8.05	樹脂	
8.71	樹脂	

40

【 0 0 6 0 】

式 (I) の化合物のための配合実施例

式 (I) の化合物の配合物、例えば、乳化性濃縮物、溶液、粒剤、粉剤、及び水和性粉末の製造のための作業手順は、WO 9 7 / 3 3 8 9 0 中に記載されている。

生物学の実施例：殺真菌作用

実施例 B - 1 : プキニア・レコンジタ (P u c c i n i a r e c o n d i t a) / 小麦に対する作用 (小麦上の茶色さび病 (B r o w n r u s t))

1 週齢の小麦植物栽培変種アリナ (A r i n a) を、スプレー室内で、配合されたテスト化合物 (0 . 0 2 % 活性成分) で処理する。適用から 1 日後に、小麦植物に、上記テスト植物上に孢子懸濁液 (1×10^5 夏孢子 / ml) をスプレーすることにより接種する。 2 0

50

及び95%相対湿度で2日間のインキュベーション期間の後、植物を20%及び60%相対湿度で8日間温室内に保つ。上記病気の発生を接種から10日後に評価する。

【0061】

表1~11の化合物は上記テストにおいて良好な活性を示す(<20%侵襲)。

実施例B-2:ポドスファエラ・リユーコトリチャ(Podosphaera leucotricha) / リンゴに対する作用(リンゴ上のうどんこ病(Powdery mildew))

5週齢のリンゴの苗木栽培変種McIntoshを、スプレー室内で、配合されたテスト化合物(0.002%活性成分)で処理する。適用から1日後に、リンゴ植物に、上記テスト植物上に、りんごのうどんこ粉に感染した植物を振ることにより接種する。22%及び60%相対湿度で、14/10時間(明/暗)の光レジームの下で12時間インキュベートした後、上記病気の発生を評価する。表1~11の化合物は上記テストにおいて良好な活性を示す。化合物1.01, 1.02, 1.03, 1.04, 1.05, 1.30, 1.35, 1.38, 1.39, 1.40, 1.42, 1.71, 1.72, 1.76, 2.02, 2.03, 2.05, 2.35, 2.71, 3.01, 3.02, 3.03, 3.71, 4.02, 4.03, 4.71, 5.02, 5.03, 5.71, 8.02, 8.03, 8.04、及び8.71は強い効果を示す(<20%侵襲)。

10

【0062】

実施例B-3:ベンチュリア・イナエクアリス(Venturia inaequalis) / リンゴに対する作用(リンゴ上のかさ病(Scab))

4週齢のリンゴの苗木栽培変種McIntoshをスプレー室内で、配合されたテスト化合物(0.02%活性成分)で処理する。適用から1日後に、リンゴ植物に、上記テスト植物上に孢子懸濁液(4×10^5 分生子/ml)をスプレーすることにより接種する。21

20

及び95%相対湿度で4日間インキュベートした後、上記植物を温室内に21%及び60%相対湿度で4日間置く。21%及び95%相対湿度でさらに4日間インキュベートした後、上記病気の発生を評価する。表1~11の化合物は、上記テストにおいて良好な活性を示す。化合物1.01, 1.02, 1.03, 1.04, 1.05, 1.30, 1.35, 1.38, 1.39, 1.40, 1.42, 1.71, 1.72, 1.76, 2.02, 2.03, 2.05, 2.35, 2.71, 3.01, 3.02, 3.03, 3.71, 4.02, 4.03, 4.71, 5.02, 5.03, 5.71, 8.02, 8.03, 8.04、及び8.71は、強い効果を示す(<20%侵襲)。

30

【0063】

実施例B-4:エリシフェ・グラミニス(Erysiphe graminis) / 大麦に対する作用(大麦上のうどんこ病)

1週齢の大麦植物栽培変種Expressを、スプレー室内で、配合されたテスト化合物(0.02%活性成分)で処理する。適用から1日後に、大麦植物に、上記テスト植物上に、うどんこ病に感染した植物を振ることにより接種する。温室内で20/18(昼/夜)及び60%相対湿度で6日間インキュベートした後、上記病気の発生を評価する。

表1~11の化合物は、上記テストにおいて良好な活性を示す。化合物1.01, 1.02, 1.03, 1.04, 1.05, 1.30, 1.35, 1.38, 1.39, 1.40, 1.42, 1.71, 1.72, 1.76, 2.02, 2.03, 2.05, 2.35, 2.71, 3.01, 3.02, 3.03, 3.71, 4.02, 4.03, 4.71, 5.02, 5.03, 5.71, 8.02, 8.03, 8.04、及び8.71は、強い効果を示す(<20%侵襲)。

40

【0064】

実施例B-5:ボトリティス・シネレア(Botrytis cinerea) / リンゴに対する作用(リンゴ果実上の貴腐(Botrytis))

リンゴの果実栽培変種Golden Delicious内に、3つの穴をあけ、そして各々に30µl滴の配合されたテスト化合物(0.002%活性成分)を満たす。適用から2時間後に、50µlの、B.cinereaの孢子懸濁液(4×10^5 分生子/ml)

50

を、上記適用部位にピペットで入れる。栽培室内で22℃で7日間インキュベートした後、上記病気の発生を評価する。

【0065】

表1～11の化合物は上記テストにおいて良好な活性を示す。化合物1.01, 1.02, 1.03, 1.04, 1.05, 1.30, 1.35, 1.38, 1.39, 1.40, 1.42, 1.71, 1.72, 1.76, 2.02, 2.03, 2.05, 2.35, 2.71, 3.01, 3.02, 3.03, 3.71, 4.02, 4.03, 4.71, 5.02, 5.03, 5.71, 8.02, 8.03, 8.04、及び8.71は、ひじょうに強い効果を示す(<10%侵襲)。

【0066】

実施例B-6：ボトリティス・シネレア/ブドウに対する作用(ブドウ上の貴腐)

5週齢のブドウの苗木栽培変種Gutedelを、スプレー室内で、配合されたテスト化合物(0.02%活性成分)で処理する。適用から2日後に、ブドウ植物に、上記テスト植物上に、孢子懸濁液(1×10^6 分生子/ml)をスプレーすることにより接種する。温室内で21℃及び95%相対湿度で4日間インキュベートした後、上記病気の発生を評価する。表1～11の化合物は上記テストにおいて良好な活性を示す。化合物1.01, 1.02, 1.03, 1.04, 1.05, 1.30, 1.35, 1.38, 1.39, 1.40, 1.42, 1.71, 1.72, 1.76, 2.02, 2.03, 2.05, 2.35, 2.71, 3.01, 3.02, 3.03, 3.71, 4.02, 4.03, 4.71, 5.02, 5.03, 5.71, 8.02, 8.03, 8.04、及び8.71は、ひじょうに強い効果を示す(<10%侵襲)。

【0067】

実施例B-7：ボトリティス・シネレア/トマトに対する作用(トマト上の貴腐)

4週齢のトマト植物栽培変種Roter Gnomを、スプレー室内で、配合されたテスト化合物(0.002%活性成分)で処理する。適用から2日後に、トマト植物に、上記テスト植物上に孢子懸濁液(1×10^5 分生子/ml)をスプレーすることにより接種する。栽培室内で20℃及び95%相対湿度で4日間インキュベートした後、上記病気を評価する。表1～11の化合物は、上記テストにおいて良好な活性を示す。化合物1.01, 1.02, 1.03, 1.04, 1.05, 1.30, 1.35, 1.38, 1.39, 1.40, 1.42, 1.71, 1.72, 1.76, 2.02, 2.03, 2.05, 2.35, 2.71, 3.01, 3.02, 3.03, 3.71, 4.02, 4.03, 4.71, 5.02, 5.03, 5.71, 8.02, 8.03, 8.04、及び8.71は、ひじょうに強い効果を示す(<10%侵襲)。

【0068】

実施例B-8：ピレノフォーラ・テレス(Pyrenophora teres)/大麦に対する作用(大麦上の網斑病(Net blotch))

1週齢の大麦植物栽培変種Expressを、スプレー室内で、配合されたテスト化合物(0.002%活性成分)で処理する。適用から2日後に、大麦植物に、上記テスト植物上に孢子懸濁液(3×10^4 分生子/ml)をスプレーすることにより接種する。20℃及び95%相対湿度で2日間のインキュベーション後、植物を、温室内で20℃及び60%相対湿度で2日間保つ。表1～11の化合物は上記テストにおいて良好な活性を示す。化合物1.01, 1.02, 1.03, 1.04, 1.05, 1.30, 1.35, 1.38, 1.39, 1.40, 1.42, 1.71, 1.72, 1.76, 2.02, 2.03, 2.05, 2.35, 2.71, 3.01, 3.02, 3.03, 3.71, 4.02, 4.03, 4.71, 5.02, 5.03, 5.71, 8.02, 8.03, 8.04、及び8.71は、強い効果を示す(<20%侵襲)。

【0069】

実施例B-9：セプトリア・ノドラム(Septoria nodorum)/小麦に対する作用(小麦上のSeptoria葉斑(leaf spot))

1週齢の小麦植物栽培変種Arinaを、スプレー室内に配合されたテスト化合物(0.

10

20

30

40

50

0.2% 活性成分) で処理する。適用から 1 日後に、小麦植物に、上記テスト植物上に孢子懸濁液 (5×10^5 分生子/ml) をスプレーすることにより接種する。20% 及び 95% 相対湿度で 1 日間インキュベートした後、植物を温室内で 20% 及び 60% 相対湿度で 10 日間保つ。上記病気の発生を接種から 11 日後に評価する。表 1 ~ 11 の化合物は、上記テストにおいて良好な活性を示す。化合物 1.01, 1.02, 1.03, 1.04, 1.05, 1.30, 1.35, 1.38, 1.39, 1.40, 1.42, 1.71, 1.72, 1.76, 2.02, 2.03, 2.05, 2.35, 2.71, 3.01, 3.02, 3.03, 3.71, 4.02, 4.03, 4.71, 5.02, 5.03, 5.71, 8.02, 8.03, 8.04、及び 8.71 は、強い効果を示す (< 20% 侵襲)。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	
A 0 1 N 43/36	(2006.01)	A 0 1 N 43/36	A
A 0 1 P 3/00	(2006.01)	A 0 1 P 3/00	
C 0 7 B 61/00	(2006.01)	C 0 7 B 61/00	3 0 0

(72)発明者 エベルレ, マルティン
 スイス国, ツェーハー - 4 1 0 3 ボットミンゲン, アステルハグシュトラーセ 2 2

(72)発明者 バルター, ハラルト
 スイス国, ツェーハー - 4 1 1 8 ローデルスドルフ, キルフマツトシュトラーセ 1 2 ペー

審査官 鳥居 福代

(56)参考文献 特開平 0 2 - 1 5 7 2 6 6 (J P , A)
 特開平 0 9 - 3 0 1 9 7 4 (J P , A)
 国際公開第 9 7 / 0 3 9 6 3 0 (W O , A 1)
 特開平 0 6 - 1 9 9 8 0 3 (J P , A)
 特開平 0 5 - 2 2 1 9 9 4 (J P , A)

(58)調査した分野(Int.Cl. , D B 名)
 C07D 207/00
 C07D 405/00
 C07D 409/00
 A01N 1/00-65/48
 A01P 1/00-23/00
 CAplus/REGISTRY(STN)