

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第5432432号
(P5432432)

(45) 発行日 平成26年3月5日 (2014.3.5)

(24) 登録日 平成25年12月13日 (2013.12.13)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 C 57/38 (2006.01)

A O 1 N 43/56 (2006.01)

A O 1 N 43/58 (2006.01)

A O 1 N 43/72 (2006.01)

A O 1 N 43/90 (2006.01)

C O 7 C 57/38

A O 1 N 43/56

A O 1 N 43/56

A O 1 N 43/58

A O 1 N 43/72

E

F

Z

請求項の数 3 (全 146 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2006-522945 (P2006-522945)
 (86) (22) 出願日 平成16年8月2日 (2004.8.2)
 (65) 公表番号 特表2007-502255 (P2007-502255A)
 (43) 公表日 平成19年2月8日 (2007.2.8)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2004/008638
 (87) 国際公開番号 W02005/016873
 (87) 国際公開日 平成17年2月24日 (2005.2.24)
 審査請求日 平成19年8月1日 (2007.8.1)
 審判番号 不服2012-1543 (P2012-1543/J1)
 審判請求日 平成24年1月26日 (2012.1.26)
 (31) 優先権主張番号 10337497.3
 (32) 優先日 平成15年8月14日 (2003.8.14)
 (33) 優先権主張国 ドイツ (DE)

(73) 特許権者 507203353
 バイエル・クロップサイエンス・アーゲー
 BAYER CROPSCIENCE A
 G
 ドイツ国、40789・モンハイム、アル
 フレートーノベルーシュトラッセ・50
 (74) 代理人 110001173
 特許業務法人川口国際特許事務所
 (72) 発明者 フイツシャー、ライナー
 ドイツ国、40789・モンハイム、ネリ
 ーザクスーシュトラッセ・23
 (72) 発明者 プレトシュナイダー、トーマス
 ドイツ国、53797・ローマー、タール
 シュトラッセ・29・ペー

最終頁に続く

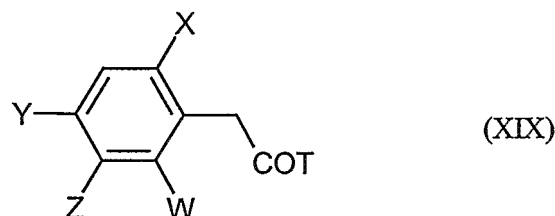
(54) 【発明の名称】 4-ビフェニル置換ピラゾリジン-3, 5-ジオン誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 (X I X)

【化1】



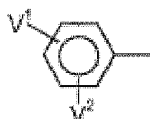
10

(式中、

Xは塩素又はメチルを表し、

Zは

【化2】

(式中、V¹は4-フルオロを表し且つV²は水素を表すか、又はV¹は3-クロロを表

20

し且つ V^2 は 4-フルオロを表す) を表し、

W 及び Y は、互いに独立して、水素又はメチルを表し、

T はカルボン酸を活性化するための試薬であって、カルボニルジイミダゾール、ジシクロヘキシルカルボジイミド、 $POCl_3$ 、 $BOP-Cl$ 、塩化チオニル、塩化オキサリル、ホスゲン、トルエンスルホニルクロリド又はクロロギ酸エステルから選択されるものによって導入される脱離基を表す)

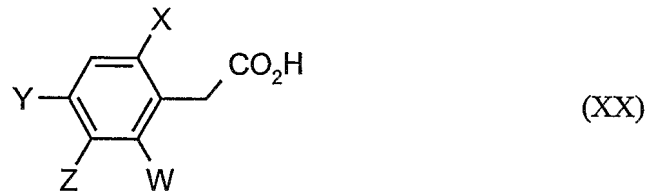
の化合物。

【請求項 2】

式 (XX)

【化 3】

10



(式中、W、X、Y 及び Z は請求項 1 で定義した通りである)

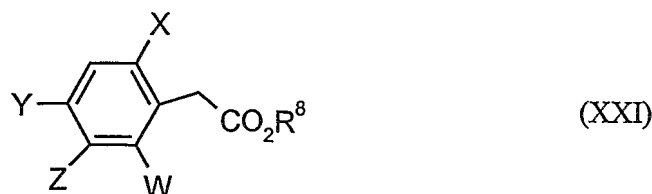
の化合物。

【請求項 3】

式 (XXI)

【化 4】

20



(式中、W、X、Y 及び Z は請求項 1 で定義した通りであり、 R^8 は C_1-C_8 -アルキルを表す)

の化合物。

30

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規 4-ビフェニル置換ピラゾリジン-3, 5-ジオン誘導体、この複数の製造方法並びにこの有害生物防除剤及び／又は除草剤及び／又は殺微生物剤としての使用に関する。また、本発明は、前記 4-ビフェニル置換ピラゾリジン-3, 5-ジオン誘導体と少なくとも一つの作物植物適合性改善化合物とを含有し、種々の有用植物の栽培において特に良い効果を伴って選択的雑草防除に使用できる新規な選択的除草活性化合物の組み合わせに関する。

【背景技術】

40

【0002】

除草性、殺ダニ性及び殺虫性を有する 4-アリールピラゾリジン-3, 5-ジオン誘導体が、欧州特許出願公開第 508126 号、国際公開第 WO92/16150 号、同第 WO96/72165 2、同第 WO99/43649 号、同第 WO99/47525 号、同第 WO99/48869 号、同第 WO99/55673 号、同第 WO01/17351 号、同第 WO01/17352 号、同第 WO01/17353 号、同第 WO01/17972 号、同第 WO01/17973 号、同第 WO03/062244 号、同第 WO03/028446 号各公報に記載されている。また、4-アリールピラゾリジン類も知られており、これらが殺菌性を有することが記載されている (国際公開第 WO96/36229 号、同第 WO96/36615 号、同第 WO96/36616 号、同第 WO96/3663

50

3号公報)。

【0003】

しかし、特に低施用量及び低濃度では、これらの化合物の活性及び活性スペクトルは、必ずしも完全に満足できるものではない。また、これらの化合物の植物適合性は、必ずしも十分ではない。

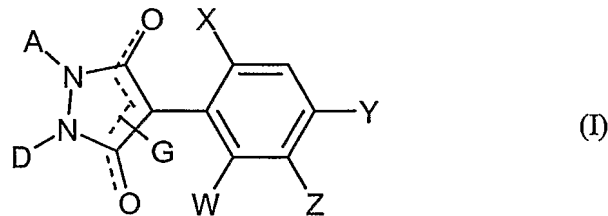
【発明の開示】

【0004】

本発明は、式(I)

【0005】

【化41】



10

〔式中、

Xはハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルケニルオキシ、ニトロ、シアノを表し、

20

Zはそれぞれ場合により置換されていてもよいアリール又はヘタリールを表し、

W及びYは、互いに独立して、水素、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルケニルオキシ、ニトロ又はシアノを表し、

Aはそれぞれ場合によりハロゲンで置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルコキシアルキル、場合により置換されていてもよい飽和シクロアルキルを表し、

Dは水素を表すか、又はそれぞれ場合によりハロゲンで置換されていてもよいアルキル、アルケニル又はアルコキシアルキルを表し、

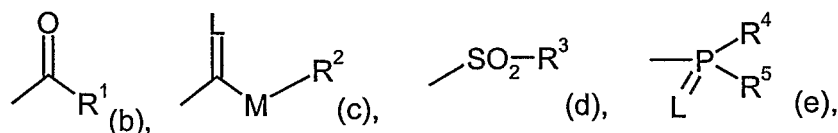
A及びDはこれらを結合している原子と一緒に、場合により少なくとも1個の別の異種原子を含有していてもよく、A部分、D部分が非置換であるか又は置換されている飽和又は不飽和6員又は7員環を表すか、又は場合により置換されていてもよい5員環を表し、

30

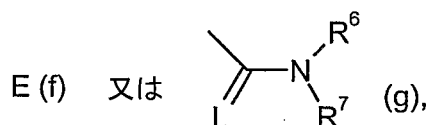
Gは水素(a)を表すか又は下記の基

【0006】

【化42】



40



の一つを表し、基中、

Eは金属イオン又はアンモニウムイオンを表し、

Lは酸素又は硫黄を表し、

Mは酸素又は硫黄を表し、

50

R¹ はそれぞれ場合によりハロゲンで置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、ポリアルコキシアルキルを表すか、又は場合によりハロゲン、アルキル又はアルコキシで置換されていてもよいシクロアルキル（該シクロアルキルは、少なくとも1個の異種原子で中断されていてもよい）を表すか、それぞれ場合により置換されていてもよいフェニル、フェニルアルキル、ヘタリール、フェノキシアルキル又はヘタリールオキシアルキルを表し、

R² はそれぞれ場合によりハロゲンで置換されていてもよいアルキル、アルケニルを表すか、又はそれぞれ場合により置換されていてもよいシクロアルキル、フェニル又はベンジルを表し、

R³、R⁴ 及び R⁵ は、互いに独立して、それぞれ場合によりハロゲンで置換されていてもよいアルキル、アルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルチオ、アルケニルチオ、シクロアルキルチオを表すか、又はそれぞれ場合により置換されていてもよいフェニル、ベンジル、フェノキシ又はフェニルチオを表し、及び

R⁶ 及び R⁷ は、互いに独立して、水素を表すか、それぞれ場合によりハロゲンで置換されていてもよいアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルコキシ又はアルコキシアルキルを表すか、場合により置換されていてもよいフェニルを表すか、場合により置換されていてもよいベンジルを表すか、又はこれらを結合しているN原子と一緒に場合により酸素又は硫黄で中断されていてもよい環を表す]

の新規化合物を提供する。

【0007】

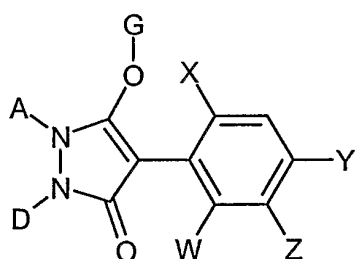
特に種々の置換基の性質に応じて、前記の式（I）の化合物は、幾何異性体及び／又は光学異性体として、又は適切な場合には慣用の方法で分離できる種々の組成の異性体混合物として存在することができる。本発明は、純粋な異性体及び異性体混合物の両方、これらの製造方法及び使用、並びにこれらを含む組成物を提供する。しかし、以下では、便宜上、前記の式（I）の化合物だけを挙げるが、意味するものは、純粋な化合物と、適切ならば種々の割合の異性体化合物を有する混合物との両方である。

【0008】

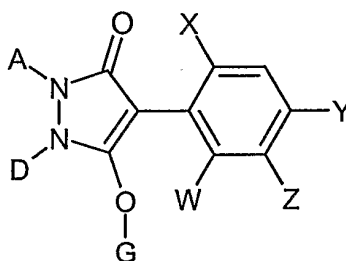
置換基Gの位置に応じて、前記の式（I）の化合物は、式（I）において点線の意味を有する式（I-A）及び（I-B）

【0009】

【化43】



(I-A)



(I-B)

の2つの異性体の形で存在することができる。

【0010】

前記の式（I-A）及び（I-B）の化合物は、混合物として及びこれらの純粋な異性体の形で存在することができる。式（I-A）及び（I-B）の化合物の混合物は、適切ならば、公知の方法で物理的方法により、例えばクロマトグラフ法により分離することができる。

【0011】

明確にするために、以下の本文では、それぞれ可能な異性体の一つだけを示す。これは

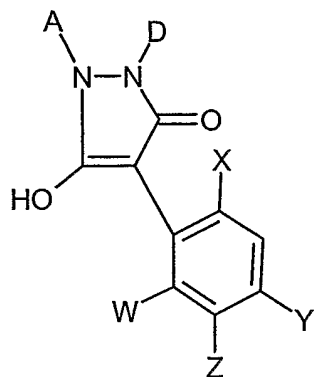
、化合物が適切ならば異性体混合物の形で又はそれぞれの他の異性体の形で存在し得ることを除外するものではない。

【0012】

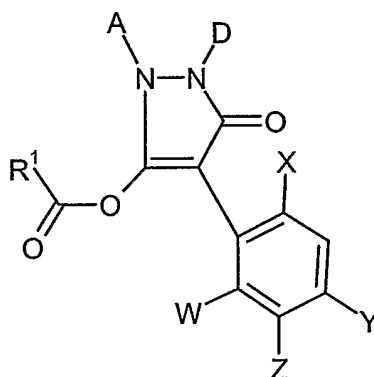
Gの種々の意味(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)及び(g)を含めると、次の主要構造(I-a)から(I-g)が生じる：

【0013】

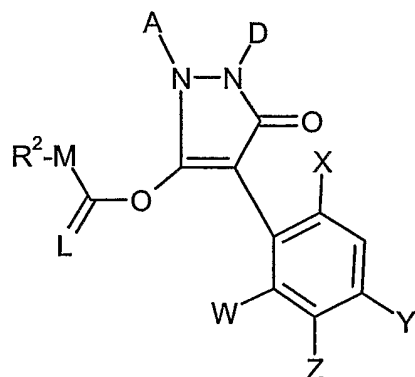
【化44】



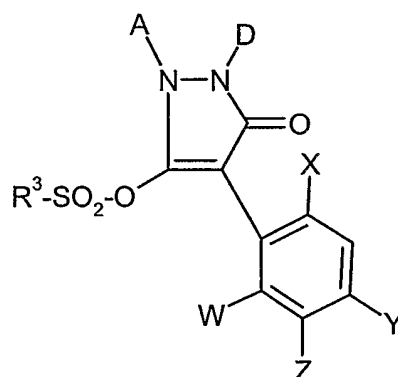
(I-a)



(I-b)



(I-c)

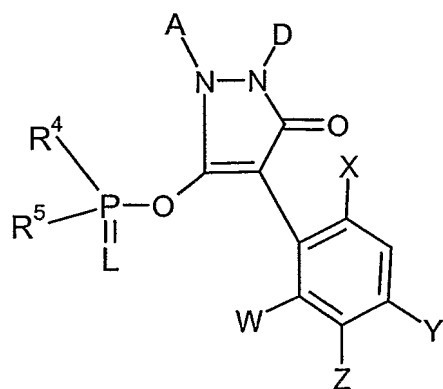


(I-d)

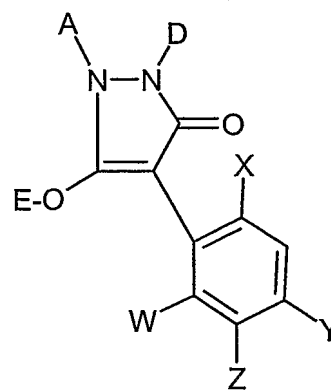
10

20

30

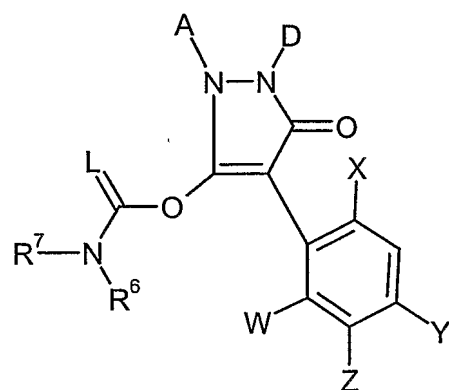


(I-e)



(I-f)

10



(I-g)

20

(式中、A、D、E、L、M、W、X、Y、Z、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 は前記で定義した通りである)。

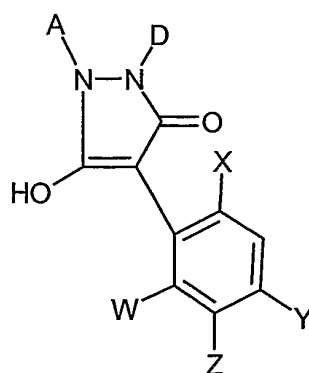
【0014】

(A) 式 (I-a)

30

【0015】

【化45】



(I-a)

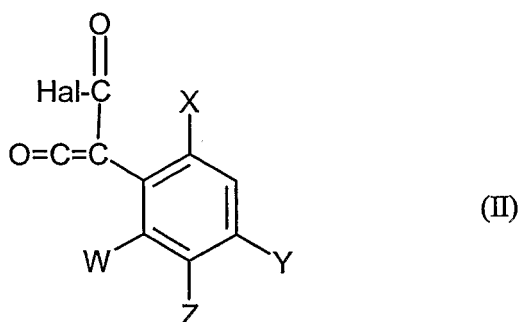
40

(式中、A、D、W、X、Y及びZは前記で定義した通りである)
の置換3-ヒドロキシ-4-フェニル-5-オキソピラズリン類又はこのジオン類が、

(α) 式 (I I)

【0016】

【化 4 6】



10

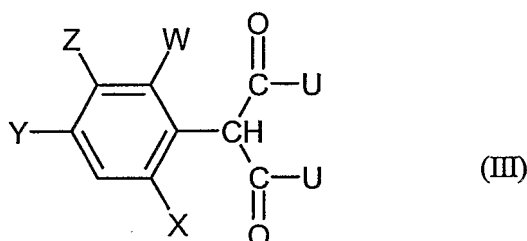
〔式中、W、X、Y及びZは前記で定義した通りであり及びHalはハロゲン（特に塩素又は臭素）を表す〕

のハロクロカルボニルケトン又は

(β) 式 (I I I)

【0017】

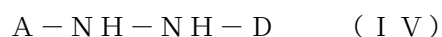
【化 4 7】



20

〔式中、W、X、Y及びZは前記で定義した通りであり及びUはNH₂又はC₁－C₈－アルコキシを表す〕

のマロン酸誘導体を、式 (I V)



〔式中、A及びDは前記で定義した通りである〕

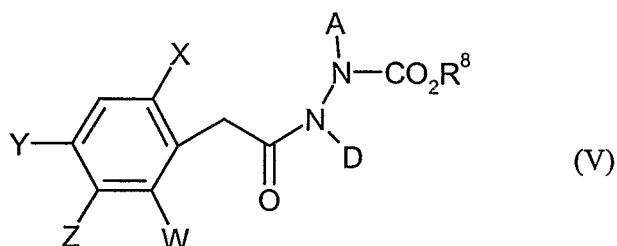
のヒドラジンと、適切ならば希釈剤の存在下で及び適切ならば塩基の存在下で反応させるか、又は

30

(γ) 式 (V)

【0018】

【化 4 8】



40

〔式中、A、D、W、X、Y及びZは前記で定義した通りであり及びR⁸はC₁－C₈－アルキルを表す〕

の化合物を、適切ならば希釈剤の存在下で及び適切ならば塩基の存在下で反応させると得られることが見出された。

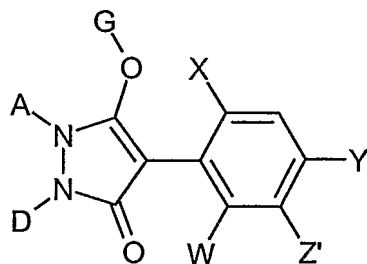
【0019】

(B) また、前記の式 (I - a) から (I - g) (式中、A、D、G、W、X、Y及びZは前記で定義した通りである) の化合物が、式 (I' - a) から (I' - g)

【0020】

50

【化 4 9】



(I'-a) から (I'-g)

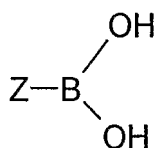
(式中、A、D、G、W、X 及び Y は前記で定義した通りであり及び Z' は塩素、臭素、ヨウ素を表し、好ましくはヨウ素を表す)

10

の化合物を、式 (VI)

【0021】

【化 50】



(VI)

(式中、Z は前記で定義した通りである)

20

のボロン酸と、溶媒、塩基及び触媒（適切な触媒は、特にパラジウム錯体である）の存在下で反応させると得られる。

【0022】

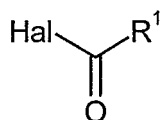
さらにまた、

(C) 前記の式 (I-b) (式中、A、D、R¹、W、X、Y 及び Z は前記で定義した通りである) の化合物が、前記の式 (I-a) (式中、A、D、W、X、Y 及び Z は前記の通りである) の化合物を、それぞれ、

(α) 式 (VII)

【0023】

【化 51】

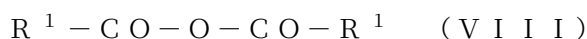


(VII)

[式中、R¹ は前記で定義した通りであり及び Hal はハロゲン（特に塩素又は臭素）を表す]

の酸ハロゲン化物、又は

(β) 式 (VIII)

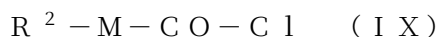


40

(式中、R¹ は前記で定義した通りである)

の無水カルボン酸と、適切ならば希釈剤の存在下で及び適切ならば酸結合剤の存在下で反応させると得られること；

(D) 前記の式 (I-c) (式中、A、D、R²、M、W、X、Y 及び Z は前記で定義した通りであり及び L は酸素を表す) の化合物が、前記の式 (I-a) (式中、A、D、W、X、Y 及び Z は前記で定義した通りである) の化合物を、それぞれ、式 (IX)



(式中、R² 及び M は前記で定義した通りである)

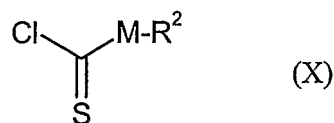
のクロロギ酸エステル又はクロロギ酸チオエステルと、適切ならば希釈剤の存在下で及び適切ならば酸結合剤の存在下で反応させると得られること；

50

(E) 前記の式 (I-c) (式中、A、D、R²、M、W、X、Y及びZは前記で定義した通りであり及びLは硫黄を表す)の化合物が、前記の式 (I-a) (式中、A、D、W、X、Y及びZは前記で定義した通りである)の化合物を、それぞれ、式 (X)

【0024】

【化52】



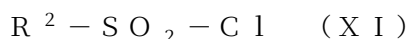
(式中、M及びR²は前記で定義した通りである)

10

のクロロモノチオギ酸エステル又はクロロジチオギ酸エステルと、適切ならば希釈剤の存在下で及び適切ならば酸結合剤の存在下で反応させると得られること；

及び

(F) 前記の式 (I-d) (式中、A、D、R³、W、X、Y及びZは前記で定義した通りである)の化合物が、前記の式 (I-a) (式中、A、D、W、X、Y及びZは前記で定義した通りである)の化合物を、それぞれ、式 (XI)



(式中、R³は前記で定義した通りである)

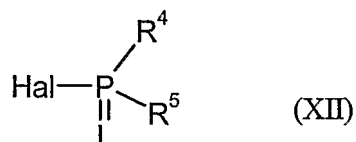
のスルホニルクロリドと、適切ならば希釈剤の存在下で及び適切ならば酸結合剤の存在下で反応させると得られること、

20

(G) 前記の式 (I-e) (式中、A、D、L、R⁴、R⁵、W、X、Y及びZは前記で定義した通りである)の化合物が、前記の式 (I-a) (式中、A、D、W、X、Y及びZは前記で定義した通りである)の化合物を、それぞれ、式 (XII)

【0025】

【化53】



30

〔式中、L、R⁴及びR⁵は前記で定義した通りであり及びHalはハロゲン（特に塩素又は臭素）を表す〕

のリン化合物と、適切ならば希釈剤の存在下で及び適切ならば酸結合剤の存在下で反応させると得られること、

(H) 前記の式 (I-f) (式中、A、D、E、W、X、Y及びZは前記で定義した通りである)の化合物が、前記の式 (I-a) (式中、A、D、W、X、Y及びZは前記で定義した通りである)の化合物を、それぞれ、式

(XIII) 及び (XIV)

【0026】

【化54】



40

〔式中、Meは一価又は二価の金属（好ましくは、アルカリ金属又はアルカリ土類金属、例えばリチウム、ナトリウム、カリウム、マグネシウム又はカルシウム）を表し、

tは1又は2の数を表し及び

R⁹、R¹⁰、R¹¹及びR¹²は互いに独立して水素又はアルキル（好ましくは、C₁

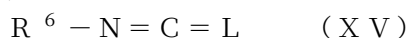
50

—C₈—アルキル)を表す]

の金属化合物又はアミンそれぞれと、適切ならば希釈剤の存在下で反応させると得られること、

(I) 前記の式 (I-g) (式中、A、D、L、R⁶、R⁷、W、X、Y及びZは前記で定義した通りである) の化合物が、前記の式 (I-a) (式中、A、D、W、X、Y及びZは前記で定義した通りである) の化合物を、それぞれ、

(α) 式 (XV)



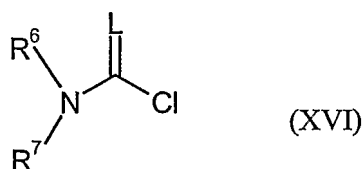
(式中、R⁶及びLは前記で定義した通りである)

のイソシアネート又はイソチオシアネートと、適切ならば希釈剤の存在下で及び適切ならば触媒の存在下で反応させるか、又は

(β) 式 (XV)

【0027】

【化55】



(式中、L、R⁶及びR⁷は前記で定義した通りである)

のカルバモイルクロリド又はチオカルバモイルクロリドと、適切ならば希釈剤の存在下で及び適切ならば酸結合剤の存在下で反応させると得られることが見出された。

【0028】

さらにまた、前記の式 (I) の新規化合物が、極めて有効な有害生物防除剤、好ましくは殺虫剤及び／又は殺ダニ剤及び／又は除草剤であることが見出された。

【0029】

意外にも、今般、ある種の4-ビフェニル置換ピラゾリジン-3,5-ジオン誘導体が、以下に記載の作物植物適合性改善化合物(葉害軽減剤/解毒剤)と一緒に使用すると、作物植物の被害を極めて効果的に防止し及び有用植物、例えば穀類ばかりではなくトウモロコシ、大豆及び稲の栽培において、望まれていない植物の選択的防除のために幅広いスペクトルをもつ併用製剤として特に都合よく使用できることが見出された。

【0030】

本発明はまた、成分として、

(a') 前記の式 (I) (式中、A、D、G、W、X、Y及びZは前記で定義した通りである) の少なくとも一つの4-ビフェニル置換ピラゾリジン-3,5-ジオン誘導体、及び

(b') 下記の化合物群：

4-ジクロロアセチル-1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン(AD-67、MON-4660)、1-ジクロロアセチルヘキサヒドロ-3,3,8a-トリメチルピロロ[1,2-a]ピリミジン-6(2H)-オン〔ジシクロノン(dicyclonon)、BAS-145138〕、4-ジクロロアセチル-3,4-ジヒドロ-3-メチル-2H-1,4-ベンゾオキサジン(ベノキサコール)、5-クロロキノリン-8-オキシ酢酸1-メチルヘキシル(クロキントセット・メキシル — 欧州特許出願公開第86750号、同第94349号、同第191736号、同第492366号公報に記載の関連化合物も参照)、3-(2-クロロベンジル)-1-(1-メチル-1-フェニルエチル)尿素(クミルロン)、α-(シアノメトキシイミノ)フェニルアセトニトリル〔シオメトリニル(cyometrinil)〕、2,4-ジクロロフェノキシ酢酸(2,4-D)、4-(2,4-ジクロロフェノキシ)酪酸(2,4-DB)、1-(1-メチル-1-フェニルエチル)-3-(4-メチルフェニル)尿素(ダイムロン)、3,6-ジクロロ-2-メトキシ安息香酸(ジカンバ)、ピペリジン-1-チオカルボン酸S-1-メ

10

20

30

40

50

チル-1-フェニルエチル (ジメピペレート)、2, 2-ジクロロ-N-(2-オキソ-
 2-(2-プロペニルアミノ)エチル)-N-(2-プロペニル)アセトアミド (DKA
 -24)、2, 2-ジクロロ-N, N-ジ-2-プロペニルアセトアミド (ジクロルミド)
 、4, 6-ジクロロ-2-フェニルピリミジン (フェンクロリム)、1-(2, 4-ジ
 クロロフェニル)-5-トリクロロメチル-1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-カル
 ボン酸エチル (フェンクロラゾール・エチル - 欧州特許出願公開第174562号及
 び同第346620号公報に記載の関連化合物も参照)、2-クロロ-4-トリフルオロ
 メチルチアゾール-5-カルボン酸フェニルメチル (フルラゾール)、4-クロロ-N-
 (1, 3-ジオキソラン-2-イルメトキシ)- α -トリフルオロアセトフェノンオキシ
 ム [フルキソフェニム (fluxofenim)]、3-ジクロロアセチル-5-(2-
 フラニル)-2, 2-ジメチルオキサゾリジン (フリラゾール、MON-13900)、
 4, 5-ジヒドロ-5, 5-ジフェニル-3-イソオキサゾールカルボン酸エチル (イソ
 キサジフェン・エチル - 国際公開第WO95/07897号公報に記載の関連化合物
 も参照)、3, 6-ジクロロ-2-メトキシ安息香酸1-(エトキシカルボニル)エチル
 [ラクチジクロール (lactidichlor)]、(4-クロロ- α -トリルオキシ)
 酢酸 (MCPA)、2-(4-クロロ- α -トリルオキシ)プロピオン酸 (メコプロッ
 プ)、1-(2, 4-ジクロロフェニル)-4, 5-ジヒドロ-5-メチル-1H-ピラ
 ゴール-3, 5-ジカルボン酸ジエチル (メフェンビル・ジエチル - 国際公開第WO
 91/07874号公報に記載の関連化合物も参照)、2-ジクロロメチル-2-メチル
 -1, 3-ジオキソラン (MG-191)、1-オキサ-4-アザスピロ [4. 5] デカ
 ン-4-カルボジチオ酸2-プロペニル (MG-838)、1, 8-ナフタル酸無水物、
 α -(1, 3-ジオキソラン-2-イルメトキシイミノ)フェニルアセトニトリル (オキ
 サベトリニル)、2, 2-ジクロロ-N-(1, 3-ジオキソラン-2-イルメチル)-
 N-(2-プロペニル)アセトアミド (PPG-1292)、3-ジクロロアセチル-2
 , 2-ジメチルオキサゾリジン (R-28725)、3-ジクロロアセチル-2, 2, 5-
 ートリメチルオキサゾリジン (R-29148)、4-(4-クロロ- α -トリル)酪酸
 、4-(4-クロロフェノキシ)酪酸、ジフェニルメトキシ酢酸、ジフェニルメトキシ酢
 酸メチル、ジフェニルメトキシ酢酸エチル、1-(2-クロロフェニル)-5-フェニル
 -1H-ピラゾール-3-カルボン酸メチル、1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-
 メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸エチル、1-(2, 4-ジクロロフェニル)
 -5-イソプロピル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸エチル、1-(2, 4-ジクロ
 ロフェニル)-5-(1, 1-ジメチルエチル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸エ
 チル、1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-フェニル-1H-ピラゾール-3-カル
 ボン酸エチル (欧州特許出願公開第269806号及び同第333131号公報に記載の
 関連化合物も参照)、5-(2, 4-ジクロロベンジル)-2-イソオキサゾリン-3-
 カルボン酸エチル、5-フェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸エチル、5-
 (4-フルオロフェニル)-5-フェニル-2-イソオキサゾリン-3-カルボン酸エチ
 ル (国際公開第WO91/08202号公報に記載の関連化合物も参照)、5-クロロキ
 ノリン-8-オキシ酢酸1, 3-ジメチルブタ-1-イル、5-クロロキノリン-8-オ
 キシ酢酸4-アリルオキシブチル、5-クロロキノリン-8-オキシ酢酸1-アリルオキ
 シプロパ-2-イル、5-クロロキノキサリン-8-オキシ酢酸メチル、5-クロロキノ
 リン-8-オキシ酢酸エチル、5-クロロキノキサリン-8-オキシ酢酸アリル、5-ク
 ロロキノリン-8-オキシ酢酸2-オキソプロパ-1-イル、5-クロロキノリン-8-
 オキシマロン酸ジエチル、5-クロロキノキサリン-8-オキシマロン酸ジアリル、5-
 クロロキノリン-8-オキシマロン酸ジエチル (欧州特許出願第582198号公報に記
 載の関連化合物も参照)、4-カルボキシクロマン-4-イル酢酸 (AC-304415
 、欧州特許出願第613618号公報参照)、4-クロロフェノキシ酢酸、3, 3'-ジ
 メチル-4-メトキシベンゾフェノン、1-ブromo-4-クロロメチルスルホニルベンゼ
 ン、1-[4-(N-2-メトキシベンゾイルスルファモイル)フェニル]-3-メチル
 尿素 [また、N-(2-メトキシベンゾイル)-4-[(メチルアミノカルボニル) アミ

10

20

30

40

50

ノ] ベンゼンスルホンアミドとしても知られている]、1-[4-(N-2-メトキシベンゾイルスルファモイル)フェニル]-3,3-ジメチル尿素、1-[4-(N-4,5-ジメチルベンゾイルスルファモイル)フェニル]-3-メチル尿素、1-[4-(N-ナフチルスルファモイル)フェニル]-3,3-ジメチル尿素、N-(2-メトキシ-5-メチルベンゾイル)-4-(シクロプロピルアミノカルボニル)ベンゼンスルホンアミド、

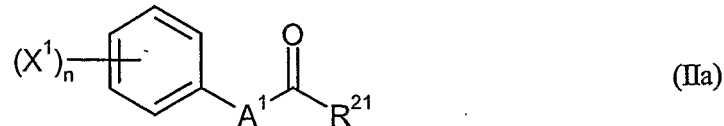
及び/又は次の一般式で定義される下記の化合物の一つ：

一般式 (I I a)

【0031】

【化56】

10

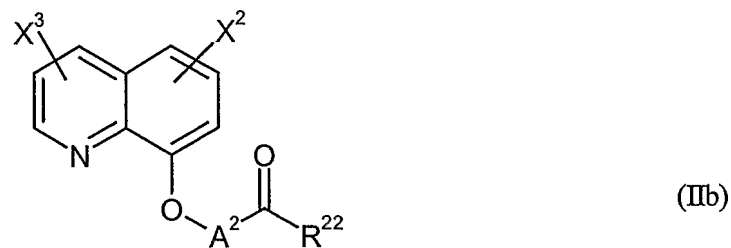


の化合物、又は一般式 (I I b)

【0032】

【化57】

20



の化合物、又は式 (I I c)

【0033】

【化58】

30



の化合物

[式中、

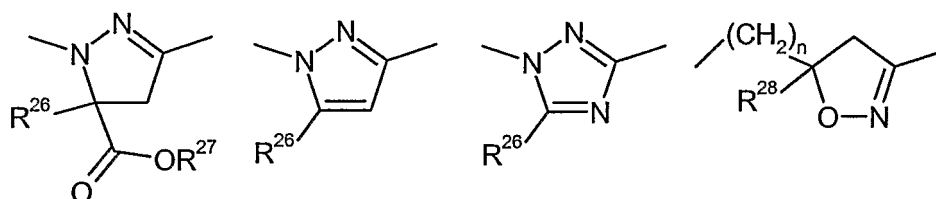
nは0から5の数を表し、

A¹は、下記に示す二価複素環式基

40

【0034】

【化59】



の一つを表し、

50

nは0から5の数を表し、

A²は1個又は2個の炭素原子を有し、場合によりC₁－C₄－アルキル及び／又はC₁－C₄－アルコキシカルボニルで置換されていてもよいアルカンジイルを表し、

R^{2 1}はヒドロキシル、メルカプト、アミノ、C₁－C₆－アルコキシ、C₁－C₆－アルキルチオ、C₁－C₆－アルキルアミノ又はジ－(C₁－C₄－アルキル)アミノを表し、

R^{2 2}はヒドロキシル、メルカプト、アミノ、C₁－C₆－アルコキシ、C₁－C₈－アルケニルオキシ、C₁－C₆－アルキルチオ、C₁－C₆－アルキルアミノ又はジ－(C₁－C₄－アルキル)アミノを表し、

R^{2 3}はそれぞれ場合により弗素、塩素及び／又は臭素で置換されていてもよいC₁－C₄－アルキルを表し、

R^{2 4}は水素を表すか、それぞれ場合により弗素、塩素及び／又は臭素で置換されていてもよいC₁－C₆－アルキル、C₂－C₆－アルケニルもしくはC₂－C₆－アルキニル、C₁－C₄－アルコキシ－C₁－C₄－アルキル、ジオキソラニル－C₁－C₄－アルキル、フリル、フリル－C₁－C₄－アルキル、チエニル、チアゾリル又はピペリジニルを表すか、又は場合により弗素、塩素及び／又は臭素又はC₁－C₄－アルキルで置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{2 5}は水素を表すか、それぞれ場合により弗素、塩素及び／又は臭素で置換されていてもよいC₁－C₆－アルキル、C₂－C₆－アルケニルもしくはC₂－C₆－アルキニル、C₁－C₄－アルコキシ－C₁－C₄－アルキル、ジオキソラニル－C₁－C₄－アルキル、フリル、フリル－C₁－C₄－アルキル、チエニル、チアゾリル又はピペリジニルを表すか、又は場合により弗素、塩素及び／又は臭素又はC₁－C₄－アルキルで置換されていてもよいフェニルを表すか、又はまたR^{1 7}とR^{1 8}は一緒になってC₃－C₆－アルカンジイル又はC₂－C₅－オキサアルカンジイル（これらはそれぞれ、場合によりC₁－C₄－アルキル、フェニル、フリル、縮合ベンゼン環で置換されていてもよいし又は結合されているC原子と一緒にあって5又は6員炭素環を形成する2個の置換基で置換されていてもよい）を表し、

R^{2 6}は水素、シアノ、ハロゲンを表すか、又はそれぞれ場合により弗素、塩素及び／又は臭素で置換されていてもよいC₁－C₄－アルキル、C₃－C₆－シクロアルキル又はフェニルを表し、

R^{2 7}は水素、場合によりヒドロキシル、シアノ、ハロゲン又はC₁－C₄－アルコキシで置換されていてもよいC₁－C₆－アルキル、C₃－C₆－シクロアルキル又はトリ(C₁－C₄－アルキル)シリルを表し、

R^{2 8}は水素、シアノ、ハロゲンを表すか、又はそれぞれ場合により弗素、塩素及び／又は臭素で置換されていてもよいC₁－C₄－アルキル、C₃－C₆－シクロアルキル又はフェニルを表し、

X¹はニトロ、シアノ、ハロゲン、C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－ハロアルキル、C₁－C₄－アルコキシ又はC₁－C₄－ハロアルコキシを表し、

X²は水素、シアノ、ニトロ、ハロゲン、C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－ハロアルキル、C₁－C₄－アルコキシ又はC₁－C₄－ハロアルコキシを表し、

X³は水素、シアノ、ニトロ、ハロゲン、C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－ハロアルキル、C₁－C₄－アルコキシ又はC₁－C₄－ハロアルコキシを表す、

及び／又は一般式で定義される次の化合物：

一般式 (I I d)

【0035】

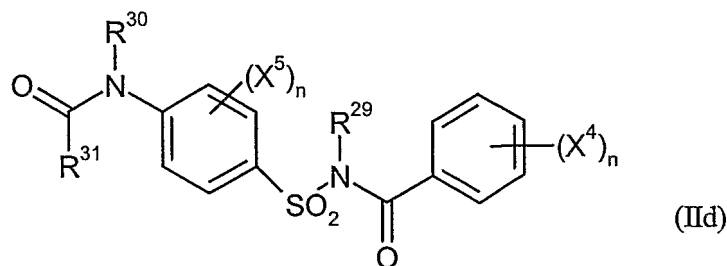
10

20

30

40

【化 6 0】

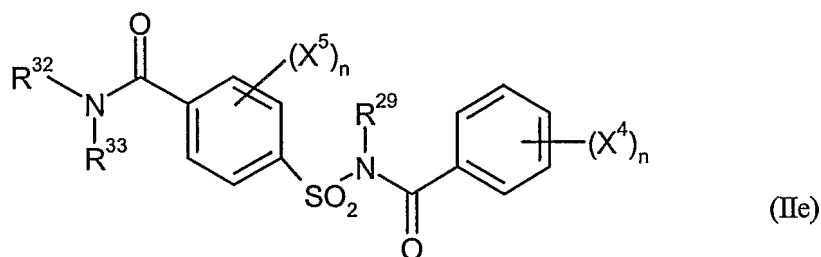


の化合物又は一般式 (I I e)

10

【 0 0 3 6 】

【化 6 1】



20

の化合物

(式中、

n は 0 から 5 の数を表し、

R²⁹ は水素又は C₁ - C₄ - アルキルを表し、R³⁰ は水素又は C₁ - C₄ - アルキルを表し、

R³¹ は水素を表すか、又はそれぞれ場合によりシアノ、ハロゲン又は C₁ - C₄ - アルコキシで置換されていてもよい C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルアミノ又はジ- (C₁ - C₄ - アルキル) アミノを表すか、又はそれぞれ場合によりシアノ、ハロゲン又は C₁ - C₄ - アルキルで置換されていてもよい C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキルオキシ、C₃ - C₆ - シクロアルキルチオ又は C₃ - C₆ - シクロアルキルアミノを表し、

30

R³² は水素を表すか、場合によりシアノ、ヒドロキシル、ハロゲン又は C₁ - C₄ - アルコキシで置換されていてもよい C₁ - C₆ - アルキルを表すか、それぞれ場合によりシアノ又はハロゲンで置換されていてもよい C₃ - C₆ - アルケニル又は C₃ - C₆ - アルキニルを表すか、又は場合によりシアノ、ハロゲン又は C₁ - C₄ - アルキルで置換されていてもよい C₃ - C₆ - シクロアルキルを表し、

R³³ は水素を表すか、場合によりシアノ、ヒドロキシル、ハロゲン又は C₁ - C₄ - アルコキシで置換されていてもよい C₁ - C₆ - アルキルを表すか、それぞれ場合によりシアノ又はハロゲンで置換されていてもよい C₃ - C₆ - アルケニル又は C₃ - C₆ - アルキニルを表すか、場合によりシアノ、ハロゲン又は C₁ - C₄ - アルキルで置換されていてもよい C₃ - C₆ - シクロアルキルを表すか、又は場合によりニトロ、シアノ、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ又は C₁ - C₄ - ハロアルコキシで置換されていてもよいフェニルを表すか、又は R³² と一緒になってそれぞれ場合により C₁ - C₄ - アルキルで置換されていてもよい C₂ - C₆ - アルカンジイル又は C₂ - C₅ - オキサアルカンジイルを表し、

40

X⁴ はニトロ、シアノ、カルボキシル、カルバモイル、ホルミル、スルファモイル、ヒドロキシル、アミノ、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ又は C₁ - C₄ - ハロアルコキシを表し、及び

X⁵ はニトロ、シアノ、カルボキシル、カルバモイル、ホルミル、スルファモイル、ヒドロキシル、アミノ、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C

50

₁ - C₄ - アルコキシ又は C₁ - C₄ - ハロアルコキシを表す)
 の中から選択される少なくとも 1 種の作物植物適合性改善化合物、
 からなる有効量の活性化合物の組み合わせを含有してなる選択性除草剤組成物を提供する。

【0037】

前記の式 (I) は、本発明の化合物の一般的な定義を提供する。前記及び下記の式に示される好ましい置換基又は基の範囲を、以下に例示する：

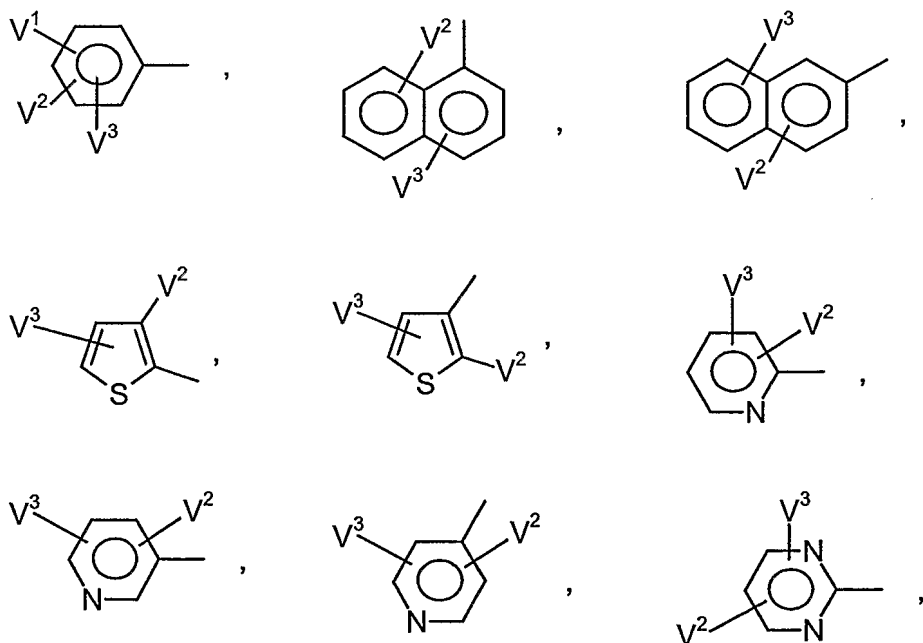
X は、好ましくは、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₃ - C₆ - アルケニルオキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ、C₃ - C₆ - ハロアルケニルオキシ、ニトロ又はシアノを表し、

W 及び Y は互いに独立して、好ましくは、水素、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ、ニトロ又はシアノを表し、

Z は、好ましくは、下記の基の

【0038】

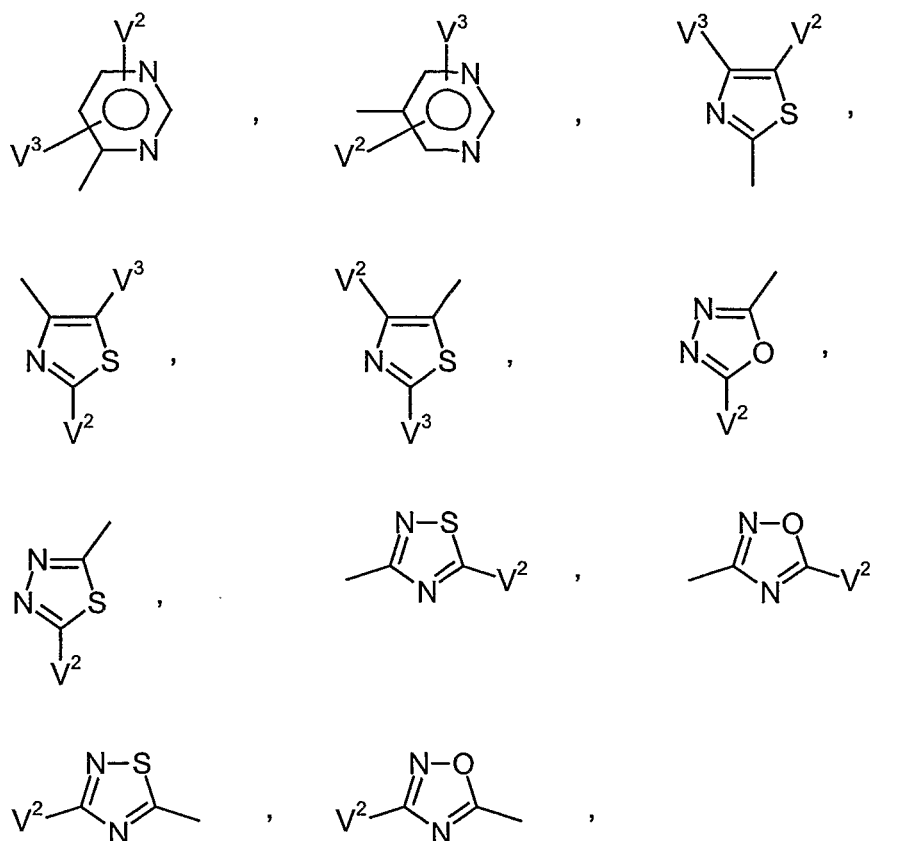
【化 6 2】



10

20

30



10

20

一つを表し、

V^1 は、好ましくは、ハロゲン、 C_1-C_{12} -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、ニトロ、シアノを表すか、又はフェニル、フェノキシ、フェノキシ- C_1-C_4 -アルキル、フェニル- C_1-C_4 -アルコキシ、フェニルチオ- C_1-C_4 -アルキル又はフェニル C_1-C_4 -アルキルチオ（これらはそれぞれ、場合によりハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -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、ニトロ又はシアノでモノ置換又は多置換されていてもよい）を表し、

30

V^2 及び V^3 は互いに独立して、好ましくは、水素、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルキル又は C_1-C_4 -ハロアルコキシを表し、

A は、好ましくは、それぞれ場合によりハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_8 -アルキル、 C_3-C_8 -アルケニルを表すか、又は場合により C_1-C_4 -アルキル、ハロゲン又は C_1-C_4 -アルコキシで置換されていてもよい C_3-C_6 -シクロアルキルを表し、

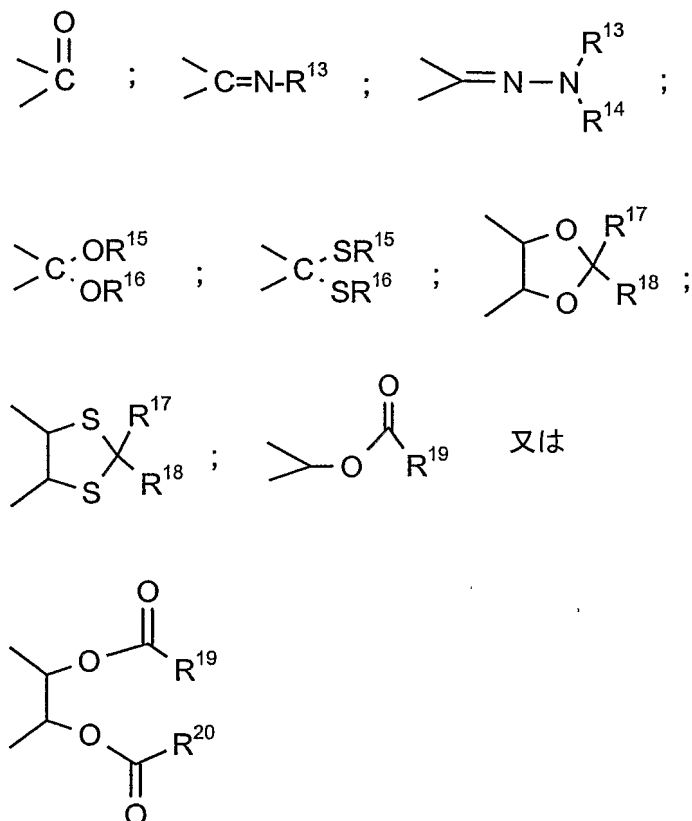
D は、好ましくは、水素を表すか、それぞれハロゲンで置換された C_1-C_8 -アルキル又は C_3-C_8 -アルケニルを表し、

40

A 及び D は一緒になって、好ましくは、それぞれ場合により置換されていてもよい C_4-C_6 -アルカンジイル又は C_4-C_6 -アルケンジイルであって、場合により 1 個のメチレン基が酸素又は硫黄で置換されていてもよいし又は場合により下記の基

【0039】

【化 6 3】



10

20

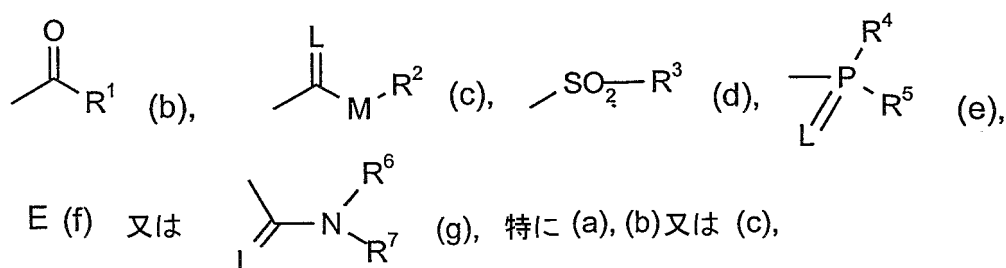
の一つを含有していてもよい $\text{C}_4 - \text{C}_6$ - アルカンジイル又は $\text{C}_4 - \text{C}_6$ - アルケンジイルを表すか（但し、可能な置換基は、それぞれ：ハロゲン、ヒドロキシル、メルカプトであるか、又はそれぞれ場合によりハロゲンで置換されていてもよい $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$ - アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルキルチオ、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ - シクロアルキル、フェニル、ベンジルオキシ又は別の $\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルカンジイルである）、又は、好ましくは、場合によりハロゲン、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ - ハロアルキル又は $\text{C}_1 - \text{C}_4$ - アルコキシでモノからトリ置換されていてもよい C_3 - アルカンジイルを表し、

30

G は、好ましくは、水素（a）を表すか又は下記の基

【0040】

【化 6 4】



40

の一つを表し、基中、

E は金属イオン又はアンモニウムイオンを表し、

L は酸素又は硫黄を表し、

M は酸素又は硫黄を表し、

R^1 は、好ましくは、それぞれ場合によりハロゲンで置換されていてもよい $\text{C}_1 - \text{C}_{20}$ - アルキル、 $\text{C}_2 - \text{C}_{20}$ - アルケニル、 $\text{C}_1 - \text{C}_8$ - アルコキシ- $\text{C}_1 - \text{C}_8$ - アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_8$ - アルキルチオ- $\text{C}_1 - \text{C}_8$ - アルキル、ポリ- $\text{C}_1 - \text{C}_8$ - アルコキ

50

シ- C_1-C_8 -アルキルを表すか、又は場合によりハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル又は C_1-C_6 -アルコキシで置換されていてもよい C_3-C_8 -シクロアルキル〔場合によりこの1個又はそれ以上（好ましくは2個以下）の直接に隣り合わない環構成要素は、酸素及び／又は硫黄で置換されていてもよい〕を表すか、

場合によりハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ又は C_1-C_6 -アルキルスルホニルで置換されていてもよいフェニルを表すか、

場合によりハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルキル又は C_1-C_6 -ハロアルコキシで置換されていてもよいフェニル- C_1-C_6 -アルキルを表すか、

10

場合によりハロゲン、 C_1-C_6 -アルキルで置換されていてもよい5員又は6員ヘタリール（例えば、ピラゾリル、チアゾリル、ピリジル、フラニル又はチエニル）を表すか、

場合によりハロゲン又は C_1-C_6 -アルキルで置換されていてもよいフェノキシ- C_1-C_6 -アルキルを表すか、又は

それぞれ場合によりハロゲン、アミノ又は C_1-C_6 -アルキルで置換されていてもよい5員又は6員ヘタリールオキシ- C_1-C_6 -アルキル（例えば、ピリジルオキシ- C_1-C_6 -アルキル、ピリミジルオキシ- C_1-C_6 -アルキル又はチアゾリルオキシ- C_1-C_6 -アルキル）を表し、

R^2 は、好ましくは、それぞれ場合によりハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_{20} -アルキル、 C_2-C_{20} -アルケニル、 C_1-C_8 -アルコキシ- C_2-C_8 -アルキル、ポリ- C_1-C_8 -アルコキシ- C_2-C_8 -アルキルを表すか、

20

場合によりハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル又は C_1-C_6 -アルコキシで置換されていてもよい C_3-C_8 -シクロアルキルを表すか、又は

それぞれ場合によりハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルキル又は C_1-C_6 -ハロアルコキシで置換されていてもよいフェニル又はベンジルを表し、

R^3 は、好ましくは、場合によりハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_8 -アルキルを表すか、又はそれぞれ場合によりハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -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、シアノ又はニトロで置換されていてもよいフェニル又はベンジルを表し、

30

R^4 及び R^5 は互いに独立して、好ましくは、それぞれ場合によりハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_8 -アルキル、 C_1-C_8 -アルコキシ、 C_1-C_8 -アルキルアミノ、ジ(C_1-C_8 -アルキル)アミノ、 C_1-C_8 -アルキルチオ、 C_2-C_8 -アルケニルチオ、 C_3-C_7 -シクロアルキルチオを表すか、又はそれぞれ場合によりハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキル又は C_1-C_4 -ハロアルキルで置換されていてもよいフェニル、フェノキシ又はフェニルチオを表し、

R^6 及び R^7 は、互いに独立して、好ましくは、水素を表すか、それぞれ場合によりハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_8 -アルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_1-C_8 -アルコキシ、 C_3-C_8 -アルケニル、 C_1-C_8 -アルコキシ- C_1-C_8 -アルキルを表すか、場合によりハロゲン、 C_1-C_8 -ハロアルキル、 C_1-C_8 -アルキル又は C_1-C_8 -アルコキシで置換されていてもよいフェニルを表すか、場合によりハロゲン、 C_1-C_8 -アルキル、 C_1-C_8 -ハロアルキル又は C_1-C_8 -アルコキシで置換されていてもよいベンジルを表すか、又は R^6 及び R^7 が一緒になって場合により C_1-C_4 -アルキルで置換されていてもよい C_3-C_6 -アルキレン基（場合によりこの1個のメチレン基は、酸素又は硫黄で置換されていてもよい）を表し、

40

R^{1-3} は、好ましくは、水素を表すか、それぞれ場合によりハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_8 -アルキル又は C_1-C_8 -アルコキシを表すか、又は場合によりハロ

50

ゲン、 C_1-C_4 -アルキル又は C_1-C_4 -アルコキシで置換されていてもよい C_3-C_8 -シクロアルキル（場合によりこの1個のメチレン基は、酸素又は硫黄で置換されていてもよい）を表すか、又はそれぞれ場合によりハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -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、ニトロ又はシアノで置換されていてもよいフェニル、フェニル- C_1-C_4 -アルキル又はフェニル- C_1-C_4 -アルコキシを表し、

R^{14} は、好ましくは、水素又は C_1-C_8 -アルキルを表すか、又は

R^{13} 及び R^{14} は一緒になって、好ましくは、 C_4-C_6 -アルカンジイルを表し、

R^{15} 及び R^{16} は同一であるか又は異なり、好ましくは、 C_1-C_6 -アルキルを表すか、又は

10

R^{15} 及び R^{16} は一緒になって、好ましくは、場合により C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキルで置換されていてもよい C_2-C_4 -アルカンジイルを表すか、又は場合によりハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、ニトロ又はシアノで置換されていてもよいフェニルで置換されていてもよい C_2-C_4 -アルカンジイルを表し、

R^{17} 及び R^{18} は、互いに独立して、好ましくは、水素を表すか、場合によりハロゲンで置換されていてもよい C_1-C_8 -アルキルを表すか、又は場合によりハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -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、ニトロ又はシアノで置換されていてもよいフェニルを表すか、又は

R^{17} 及び R^{18} は、これらを結合している炭素原子と一緒に、好ましくは、カルボニル基を表すか、又は場合によりハロゲン、 C_1-C_4 -アルキル又は C_1-C_4 -アルコキシで置換されていてもよい C_5-C_7 -シクロアルキル（場合によりこの1個のメチレン基は、酸素又は硫黄で置換されていてもよい）を表し、

20

R^{19} 及び R^{20} は、互いに独立して、好ましくは、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_2-C_{10} -アルケニル、 C_1-C_{10} -アルコキシ、 C_1-C_{10} -アルキルアミノ、 C_3-C_{10} -アルケニルアミノ、ジー（ C_1-C_{10} -アルキル）アミノ又はジー（ C_3-C_{10} -アルケニル）アミノを表す。

【0041】

好ましいと述べた基の定義において、ハロゲンは、弗素、塩素、臭素及びヨウ素を表し、特に弗素、塩素及び臭素を表す。

30

【0042】

Wは、特に好ましくは、水素、弗素、塩素、臭素、メチル、エチル、メトキシ又はエトキシを表し、

Xは、特に好ましくは、弗素、塩素、臭素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_3-C_4 -アルケニルオキシ、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_3-C_4 -ハロアルケニルオキシ、ニトロ又はシアノを表し、

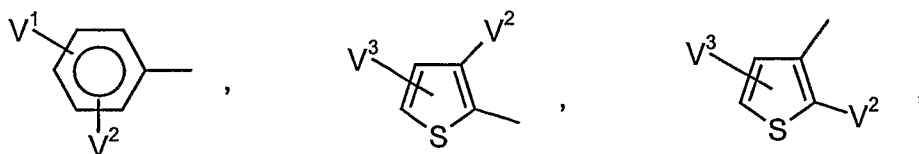
Yは、特に好ましくは、水素、弗素、塩素、臭素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_2 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ又は C_1-C_2 -ハロアルコキシを表し、

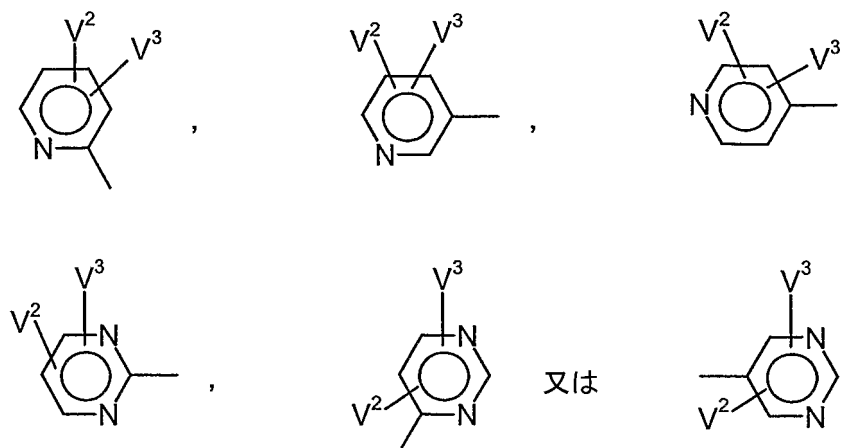
Zは、特に好ましくは、下記の基

【0043】

40

【化65】





10

の一つを表し、

V^1 は、特に好ましくは、水素、弗素、塩素、臭素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_2 -ハロアルキル、 C_1-C_2 -ハロアルコキシ、ニトロ又はシアノを表すか、又はフェニル、フェノキシ、フェノキシ- C_1-C_2 -アルキル、フェニル- C_1-C_2 -アルコキシ、フェニルチオ- C_1-C_2 -アルキル又はフェニル- C_1-C_2 -アルキルチオ（これらはそれぞれ、場合により弗素、塩素、臭素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_2 -ハロアルキル、 C_1-C_2 -ハロアルコキシ、ニトロ又はシアノでモノ又はジ置換されていてもよい）を表し、

20

V^2 及び V^3 は、互いに独立して、特に好ましくは、水素、弗素、塩素、臭素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_2 -ハロアルキル又は C_1-C_2 -ハロアルコキシを表し、

A は、特に好ましくは、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -アルケニル又は C_3-C_6 -シクロアルキルを表し、

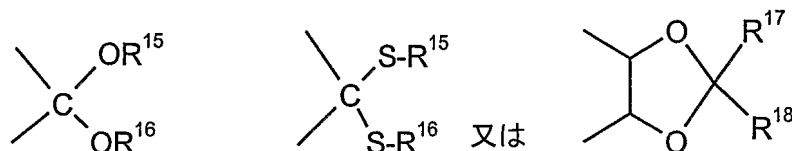
D は、特に好ましくは、水素、 C_1-C_6 -アルキル又は C_3-C_6 -アルケニルを表し、

A 及び D は一緒になって、特に好ましくは、場合により置換されていてもよい C_4-C_5 -アルカンジイルであって、場合により 1 個のメチレン基がカルボニル基、酸素又は硫黄で置換されていてもよいし又は場合により下記の基

30

【0044】

【化66】



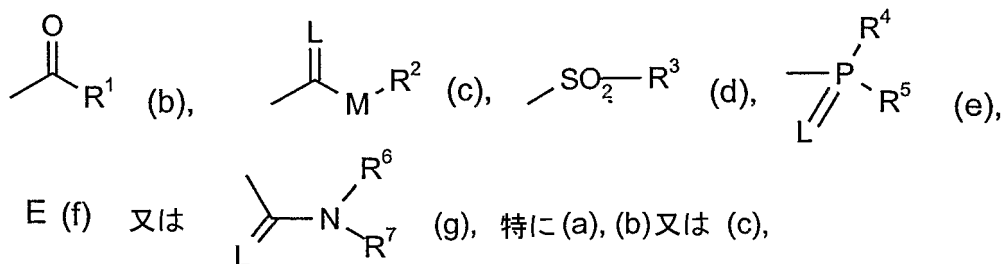
40

の一つを含有していてもよい C_4-C_5 -アルカンジイルを表すか（但し、可能な置換基は、ヒドロキシル、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ又は別の C_1-C_4 -アルカンジイルである）、又は場合により弗素、塩素、トリフルオロメチル、メチル、エチル又はメトキシでモノ又はジ置換されていてもよい C_3 -アルカンジイルを表し、

G は、特に好ましくは、水素（a）を表すか又は下記の基

【0045】

【化 6 7】



の一つを表し、基中、

E は金属イオン又はアンモニウムイオンを表し、

L は酸素又は硫黄を表し、

M は酸素又は硫黄を表し、

R¹ は、特に好ましくは、C₁－C₈－アルキル、C₂－C₈－アルケニル、C₁－C₄－アルコキシ－C₁－C₂－アルキル、C₁－C₄－アルキルチオ－C₁－C₂－アルキル（これらはそれぞれ、場合により弗素又は塩素でモノからトリ置換されていてもよい）を表すか、又は場合により弗素、塩素、C₁－C₂－アルキル又はC₁－C₂－アルコキシでモノ又はジ置換されていてもよく、場合により1個又は2個の直接に隣り合わない環構成要素が酸素で置換されていてもよいC₃－C₆－シクロアルキルを表すか、

場合により弗素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－アルコキシ、C₁－C₂－ハロアルキル又はC₁－C₂－ハロアルコキシでモノ又はジ置換されていてもよいフェニルを表し、

R² は、特に好ましくは、C₁－C₈－アルキル、C₂－C₈－アルケニル又はC₁－C₄－アルコキシ－C₂－C₄－アルキル（これらはそれぞれ、場合により弗素でモノからトリ置換されていてもよい）を表すか、

場合によりC₁－C₂－アルキル又はC₁－C₂－アルコキシでモノ置換されていてもよいC₃－C₆－シクロアルキルを表すか、又は

フェニル又はベンジル（これらはそれぞれ、場合により弗素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、C₁－C₄－アルキル、C₁－C₃－アルコキシ、トリフルオロメチル又はトリフルオロメトキシで置換されていてもよい）を表し、

R³ は、特に好ましくは、場合により弗素でモノからトリ置換されていてもよいC₁－C₆－アルキルを表すか、又はフェニル又はベンジル（これらはそれぞれ、場合により弗素、塩素、臭素、C₁－C₄－アルキル、C₁－C₄－アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ又はニトロで置換されていてもよい）を表し、

R⁴ は、特に好ましくは、C₁－C₆－アルキル、C₁－C₆－アルコキシ、C₁－C₆－アルキルアミノ、ジ（C₁－C₆－アルキル）アミノ、C₁－C₆－アルキルチオ、C₃－C₄－アルケニルチオ、C₃－C₆－シクロアルキルチオ（これらはそれぞれ、場合により弗素でモノからトリ置換されていてもよい）を表すか、又はフェニル、フェノキシ又はフェニルチオ（これらはそれぞれ、場合により弗素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、C₁－C₃－アルコキシ、C₁－C₃－ハロアルコキシ、C₁－C₃－アルキルチオ、C₁－C₃－ハロアルキルチオ、C₁－C₃－アルキル又はトリフルオロメチルでモノ又はジ置換されていてもよい）を表し、

R⁵ は、特に好ましくは、C₁－C₆－アルコキシ又はC₁－C₆－アルキルチオを表し、

R⁶ は、特に好ましくは、水素を表すか、C₁－C₆－アルキル、C₃－C₆－シクロアルキル、C₁－C₆－アルコキシ、C₃－C₆－アルケニル、C₁－C₆－アルコキシ－C₁－C₄－アルキル（これらはそれぞれ、場合により弗素でモノからトリ置換されていてもよい）を表すか、場合により弗素、塩素、臭素、トリフルオロメチル、C₁－C₄－アルキル又はC₁－C₄－アルコキシでモノ又はジ置換されていてもよいフェニルを表すか、場合により弗素、塩素、臭素、C₁－C₄－アルキル、トリフルオロメチル又はC

10

20

30

40

50

$1-C_4$ -アルコキシでモノ置換されていてもよいベンジルを表し、

R^7 は、特に好ましくは、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_6 -アルケニル又は C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキルを表し、

R^6 及び R^7 は、一緒になって、特に好ましくは、場合によりメチル又はエチルでモノ又はジ置換されていてもよく、場合により1個のメチレン基が酸素又は硫黄で置換されていてもよい C_4-C_5 -アルキレンを表し、

R^{15} 及び R^{16} は同一でり、特に好ましくは、 C_1-C_4 -アルキルを表すか、

R^{15} 及び R^{16} は一緒になって、特に好ましくは、場合によりメチル、エチル、プロピル又はイソプロピルでモノ又はジ置換されていてもよい C_2-C_3 -アルカンジイルを表し、

R^{17} 及び R^{18} は、互いに独立して、特に好ましくは、水素を表すか、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル又は *tert*-ブチル（これらはそれぞれ、場合により弗素及び／又は塩素でモノからトリ置換されていてもよい）を表すか、又は

R^{17} 及び R^{18} は、これらを結合している炭素原子と一緒にあって、特に好ましくは、カルボニル基を表すか、又は場合によりメチル、エチル、メトキシ又はエトキシで置換されていてもよい C_5-C_6 -シクロアルキル（場合によりこの1個のメチレン基は、酸素又は硫黄で置換されていてもよい）を表す。

【0046】

特に好ましいと述べた基の定義において、ハロゲンは、弗素、塩素、臭素及びヨウ素を表し、特に弗素、塩素及び臭素を表す。

【0047】

Wは、極めて特に好ましくは、水素、塩素、メチル、エチル又は塩素を表し、

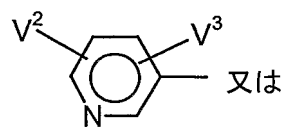
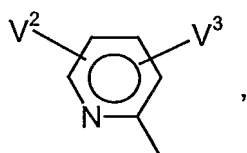
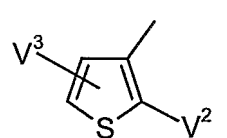
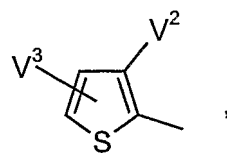
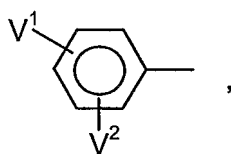
Xは、極めて特に好ましくは、塩素、メチル、エチル、プロピル、メトキシ、エトキシ、プロポキシ又はトリフルオロメチルを表し、

Yは、極めて特に好ましくは、水素、塩素又はメチルを表し、

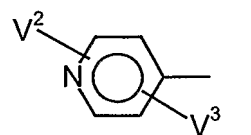
Zは、極めて特に好ましくは、下記の基

【0048】

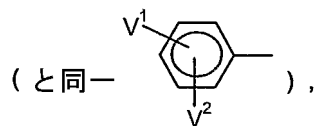
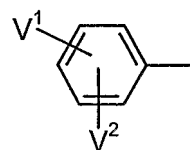
【化68】



又は



特に



の一つを表し、

V^1 は、極めて特に好ましくは、弗素、塩素、臭素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $SO_2C_2H_5$ 、 SCH_3 、フェノキシ、ニトロ又はシアノを表し、

V^2 及び V^3 は互いに独立して、極めて特に好ましくは、水素、弗素、塩素、メチル、メトキシ又はトリフルオロメチルを表し、

A は、極めて特に好ましくは、メチル、エチル、プロピル又はブチルを表し、

D は、極めて特に好ましくは、水素、メチル又はエチルを表し、

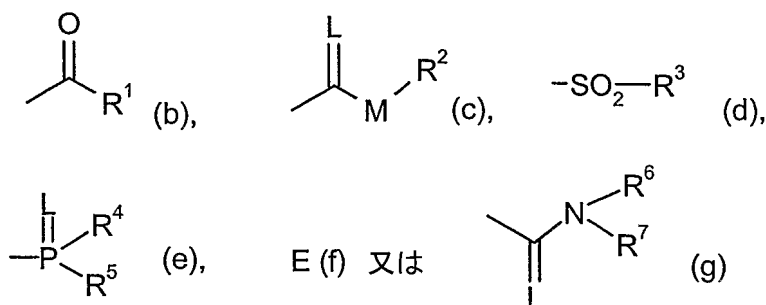
A 及び D が一緒になって、極めて特に好ましくは、場合により置換されていてもよい C_4-C_5 -アルカンジイルであって、場合により 1 個のメチレン基が酸素で置換されていてもよく、場合によりヒドロキシ、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ又は別の C_1-C_4 -アルカンジイルで置換されていてもよい) を表すか、又は場合により弗素、メチル又はトリフルオロメチルでモノ又はジ置換されていてもよい C_3 -アルカンジイルを表し、

10

G は、極めて特に好ましくは、水素 (a) を表すか又は下記の基

【0049】

【化69】



20

特に (a), (b) 又は (c)

の一つを表し、基中、

E は金属イオン均等物又はアンモニウムイオンを表し、

L は酸素又は硫黄を表し、

M は酸素又は硫黄を表し、

R^1 は、極めて特に好ましくは、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_1-C_2 -アルコキシ- C_1 -アルキル、 C_1-C_2 -アルキルチオ- C_1 -アルキル (これらはそれぞれ、場合により弗素でモノからトリ置換されていてもよい) を表すか、又はシクロプロピル又は又はシクロヘキシル (これらはそれぞれ、場合により弗素、塩素、メチル又はメトキシでモノ置換されていてもよい) を表すか、場合により弗素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル又はトリフルオロメトキシでモノ置換されていてもよいフェニルを表すか、

30

R^2 は、極めて特に好ましくは、 C_1-C_8 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル又は C_1-C_4 -アルコキシ- C_2-C_3 -アルキル (これらはそれぞれ、場合により弗素でモノ置換されていてもよい) を表すか、

又はフェニル又はベンジル (これらはそれぞれ、場合により弗素、塩素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル又はトリフルオロメトキシでモノ置換されていてもよい) を表し、

40

R^3 は、極めて特に好ましくは、メチル、エチル、*n*-プロピル又はイソプロピル (これらはそれぞれ、場合により弗素でモノからトリ置換されていてもよい) を表すか、又はフェニル又はベンジル (これらはそれぞれ、場合により弗素、塩素、臭素、メチル、*tert*-ブチル、メトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ又はニトロでモノ置換されていてもよい) を表し、

R^4 は、極めて特に好ましくは、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルアミノ、ジ (C_1-C_4 -アルキル) アミノ、 C_1-C_4 -アルキルチオ (これらはそれぞれ、場合により弗素でモノからトリ置換されていてもよい) を表すか、又はフェニル、フェノキシ又はフェニルチオ (これらはそれぞれ、場合により弗素、

50

塩素、臭素、ニトロ、シアノ、 C_1-C_2 -アルコキシ、 C_1-C_2 -フルオロアルコキシ、 C_1-C_2 -アルキルチオ、 C_1-C_2 -フルオロアルキルチオ又は C_1-C_3 -アルキルでモノ置換されていてもよい)を表し、

R^5 は、極めて特に好ましくは、水素を表すか、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ又はブチルチオを表し、

R^6 は、極めて特に好ましくは、 C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_3-C_4 -アルケニル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル(これらはそれぞれ、場合により弗素でモノからトリ置換されていてもよい)を表すか、場合により弗素、塩素、臭素、トリフルオロメチル、メチル又はメトキシでモノ置換されていてもよいフェニルを表すか、場合により弗素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル又はメトキシでモノ置換されていてもよいベンジルを表し、

R^7 は、極めて特に好ましくは、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル又はアリルを表し、

R^6 及び R^7 は、極めて特に好ましくは、場合により1個のメチレン基が酸素又は硫黄で置換されていてもよい C_4-C_5 -アルキレン基を表す。

【0050】

Wは、特別に好ましくは、水素又はメチルを表し、

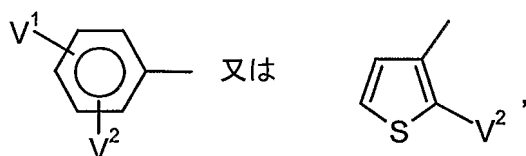
Xは、特別に好ましくは、塩素又はメチルを表し、

Yは、特別に好ましくは、水素又はメチルを表し、

Zは、特別に好ましくは、下記の基

【0051】

【化70】



の一つを表し、

V^1 は、特別に好ましくは、弗素、塩素、メチル、イソプロピル、メトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $SO_2C_2H_5$ 、 SCH_3 、フェノキシ又はニトロを表し、

V^2 は、特別に好ましくは、水素、弗素、塩素又はトリフルオロメチルを表し、

Aは、特別に好ましくは、メチル又はエチルを表し、

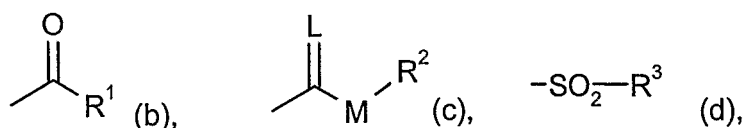
Dは、特別に好ましくは、メチル又はエチルを表し、

A及びDが一緒になって、特別に好ましくは、場合により置換されていてもよい C_4-C_5 -アルカンジイル(これは、場合により1個のメチレン基が酸素で置換されていてもよく、場合により別の C_1-C_2 -アルカンジイルで置換されていてもよい)を表すか、又は場合により弗素、メチル又はトリフルオロメチルでモノ又はジ置換されていてもよい C_3 -アルカンジイルを表し、

Gは、特別に好ましくは、水素(a)を表すか又は下記の基

【0052】

【化71】



の一つを表し、基中、

Lは酸素を表し、

Mは酸素を表し、

R¹は、特別に好ましくは、C₁ - C₆ - アルキル又はシクロプロピルを表し、

R²は、特別に好ましくは、C₁ - C₈ - アルキル又はC₁ - C₄ - アルコキシ - C₂ - C₃ - アルキルを表し、

R³は、特別に好ましくは、メチル、エチル又はイソプロピルを表す。

【0053】

前記に挙げた一般的な基又は好ましい基の定義又は例示は、所望ならば相互に組み合わせることができる、すなわちそれぞれの範囲及び好ましい範囲の間の組合せを含むことができる。これは、最終生成物及びこれに対応する前駆物質及び中間体に適用される。

10

【0054】

本発明の好ましい化合物は、好ましいものとして前記に挙げた意義の組み合わせを含む式(I)の化合物である。

【0055】

本発明の特に好ましい化合物は、特に好ましいものとして前記に挙げた意義の組み合わせを含む式(I)の化合物である。

【0056】

本発明の極めて特に好ましい化合物は、極めて特に好ましいものとして前記に挙げた意義の組み合わせを含む式(I)の化合物である。

【0057】

本発明の特別に好ましい化合物は、特別に好ましいものとして前記に挙げた意味の組み合わせを含む式(I)の化合物である。

20

【0058】

飽和又は不飽和炭化水素基、例えばアルキル又はアルケニルは、それぞれ直鎖又は分岐鎖であることができ、可能な限りは例えばアルコキシにおけるように異種原子との組み合わせを含む。

【0059】

特に指示しない限りは、場合により置換されていてよい基は、モノ置換又は多置換されることができ、多置換の場合には置換基は同一であることができるし又は異なることができる。

30

【0060】

製造実施例に挙げた化合物の他に、下記の式(I-1-a)の化合物を具体的に挙げ得る。

【0061】

【表 1】

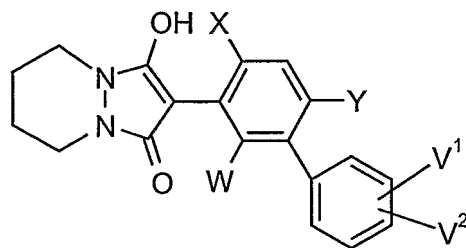


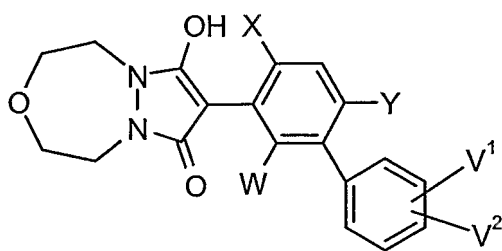
表 1 :

W	X	Y	V ¹	V ²
H	CH ₃	H	4-Cl	H
H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H
H	CH ₃	H	3-Cl	H
H	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H
H	CH ₃	H	2-Cl	4-Cl
H	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl
CH ₃	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl
H	CH ₃	H	4-CF ₃	H
H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃	H
H	CH ₃	H	4-F	H
H	CH ₃	CH ₃	4-F	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-F	H
H	CH ₃	H	4-CH ₃	H
H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H

W	X	Y	V ¹	V ²
CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H
H	Cl	H	4-Cl	H
H	Cl	H	3-Cl	H
H	Cl	H	4-CF ₃	H
H	Cl	H	4-F	H
H	Cl	H	2-Cl	4-Cl

【0062】

【表2】



10

表 2 :

W	X	Y	V ¹	V ²
H	CH ₃	H	4-Cl	H
H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H
H	CH ₃	H	3-Cl	H
H	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H
H	CH ₃	H	2-Cl	4-Cl
H	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl
CH ₃	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl
H	CH ₃	H	4-CF ₃	H
H	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃	H
H	CH ₃	H	4-F	H
H	CH ₃	CH ₃	4-F	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-F	H
H	CH ₃	H	4-CH ₃	H
H	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H

20

30

W	X	Y	V ¹	V ²
CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃	H
H	Cl	H	4-Cl	H
H	Cl	H	4-Cl	H
H	Cl	H	4-CF ₃	H
H	Cl	H	4-F	H
H	Cl	H	2-Cl	4-Cl

10

【0063】

式 (I I a)、(I I b)、(I I c)、(I I d) 及び (I I e) の作物植物適合性改善化合物 (「除草剤薬害軽減剤」) に関連して前記に挙げた基の好ましい意義を、以下に定義する。

【0064】

n は、好ましくは 0、1、2、3 又は 4 を表す。

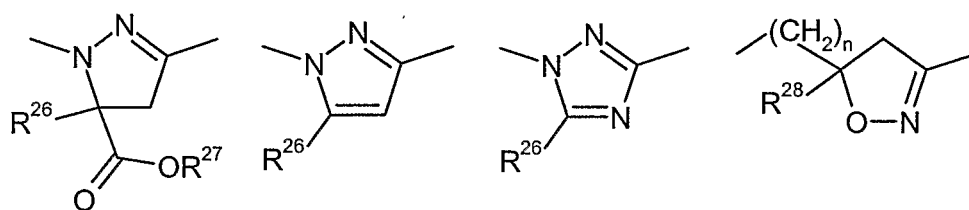
【0065】

A¹ は、好ましくは下記に示す二価複素環式基

20

【0066】

【化72】



の一つを表す。

30

【0067】

A² は、好ましくはそれぞれ場合によりメチル、エチル、メトキシカルボニル又はエトキシカルボニルで置換されていてもよいメチレン又はエチレンを表す。

【0068】

R^{2 1} は、好ましくは、ヒドロキシル、メルカプト、アミノ、メトキシ、エトキシ、n-又はi-プロポキシ、n-、i-、s-又はt-ブトキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-又はi-プロピルチオ、n-、i-、s-又はt-ブチルチオ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-又はi-プロピルアミノ、n-、i-、s-又はt-ブチルアミノ、ジメチルアミノ又はジエチルアミノを表し、

R^{2 2} は、好ましくはヒドロキシル、メルカプト、アミノ、メトキシ、エトキシ、n-又はi-プロポキシ、n-、i-、s-又はt-ブトキシ、メチルチオ、エチルチオ、n-又はi-プロピルチオ、n-、i-、s-又はt-ブチルチオ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-又はi-プロピルアミノ、n-、i-、s-又はt-ブチルアミノ、ジメチルアミノ又はジエチルアミノを表す。

40

【0069】

R^{2 3} は、好ましくは、それぞれ場合により弗素、塩素、及び／又は臭素で置換されていてもよいメチル、エチル、n-又はi-プロピルを表す。

【0070】

R^{2 4} は、好ましくは、水素を表すか、それぞれ場合により弗素及び／又は塩素で置換されていてもよいメチル、エチル、n-又はi-プロピル、n-、i-、s-又はt-ブ

50

チル、プロペニル、ブテニル、プロピニル又はブチニル、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、ジオキソラニルメチル、フリル、フリルメチル、チエニル、チアゾリル、ピペリジニルを表すか、又は場合により弗素、塩素、メチル、エチル、 n -又は i -プロピル、 n -、 i -、 s -又は t -ブチルで置換されていてもよいフェニルを表す。

【0071】

R^{25} は、好ましくは、水素を表すか、それぞれ場合により弗素及び／又は塩素で置換されていてもよいメチル、エチル、 n -又は i -プロピル、 n -、 i -、 s -又は t -ブチル、プロペニル、ブテニル、プロピニル又はブチニル、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、ジオキソラニルメチル、フリル、フリルメチル、チエニル、チアゾリル、ピペリジニルを表すか、又は場合により弗素、塩素、メチル、エチル、 n -又は i -プロピル、 n -、 i -、 s -又は t -ブチルで置換されていてもよいフェニルを表すか、又は R^{24} と一緒に基- $CH_2-O-CH_2-CH_2-$ 及び- $CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-$ （これらの基は、場合によりメチル、エチル、フリル、フェニル、縮合ベンゼン環で置換されていてもよいし、又は結合されているC原子と一緒に5又は6員炭素環を形成する2個の置換基で置換されていてもよい）の一つを表す。

10

【0072】

R^{26} は、好ましくは、水素、シアノ、弗素、塩素、臭素を表すか、又はそれぞれ場合により弗素、塩素及び／又は臭素で置換されていてもよいメチル、エチル、 n -もしくは i -プロピル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル又はフェニルを表す。

20

【0073】

R^{27} は、好ましくは、水素、場合によりヒドロキシル、シアノ、弗素、塩素、メトキシ、エトキシ、 n -又は i -プロポキシで置換されていてもよいメチル、エチル、 n -又は i -プロピル、 n -、 i -、 s -又は t -ブチルを表す。

【0074】

R^{28} は、好ましくは、水素、シアノ、弗素、塩素、臭素を表すか、又はそれぞれ場合により弗素、塩素及び／又は臭素で置換されていてもよいメチル、エチル、 n -又は i -プロピル、 n -、 i -、 s -又は t -ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル又はフェニルを表す。

30

【0075】

X^1 は、好ましくは、ニトロ、シアノ、弗素、塩素、臭素、メチル、エチル、 n -又は i -プロピル、 n -、 i -、 s -又は t -ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、 n -又は i -プロポキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシを表す。

【0076】

X^2 は、好ましくは、水素、ニトロ、シアノ、弗素、塩素、臭素、メチル、エチル、 n -又は i -プロピル、 n -、 i -、 s -又は t -ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、 n -又は i -プロポキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシを表す。

40

【0077】

X^3 は、好ましくは、水素、ニトロ、シアノ、弗素、塩素、臭素、メチル、エチル、 n -又は i -プロピル、 n -、 i -、 s -又は t -ブチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、フルオロジクロロメチル、メトキシ、エトキシ、 n -又は i -プロポキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシを表す。

【0078】

50

R^{29} は、好ましくは、水素、メチル、エチル、 n －又は i －プロピルを表す。

【0079】

R^{30} は、好ましくは、水素、メチル、エチル、 n －又は i －プロピルを表す。

【0080】

R^{31} は、好ましくは、水素を表すか、それぞれ場合によりシアノ、弗素、塩素、メトキシ、エトキシ、 n －又は i －プロポキシで置換されていてもよいメチル、エチル、 n －又は i －プロピル、 n －、 i －、 s －又は t －ブチル、メトキシ、エトキシ、 n －又は i －プロポキシ、 n －、 i －、 s －又は t －ブトキシ、メチルチオ、エチルチオ、 n －又は i －プロピルチオ、 n －、 i －、 s －又は t －ブチルチオ、メチルアミノ、エチルアミノ、 n －又は i －プロピルアミノ、 n －、 i －、 s －又は t －ブチルアミノ、ジメチルアミノ又はジエチルアミノを表すか、又はそれぞれ場合によりシアノ、弗素、塩素、臭素、メチル、エチル、 n －又は i －プロピルで置換されていてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルオキシ、シクロブチルオキシ、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシ、シクロプロピルチオ、シクロブチルチオ、シクロペンチルチオ、シクロヘキシルチオ、シクロプロピルアミノ、シクロブチルアミノ、シクロペンチルアミノ又はシクロヘキシルアミノを表す。

10

【0081】

R^{32} は、好ましくは、水素を表すか、それぞれ場合によりシアノ、ヒドロキシル、弗素、塩素、メトキシ、エトキシ、 n －又は i －プロポキシで置換されていてもよいメチル、エチル、 n －又は i －プロピル、 n －、 i －又は s －ブチルを表すか、それぞれ場合によりシアノ、弗素、塩素又は臭素で置換されていてもよいプロベニル、ブテニル、プロピニル又はブチニルを表すか、又はそれぞれ場合によりシアノ、弗素、塩素、臭素、メチル、エチル、 n －又は i －プロピルで置換されていてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルを表す。

20

【0082】

R^{33} は、好ましくは、水素を表すか、それぞれ場合によりシアノ、ヒドロキシル、弗素、塩素、メトキシ、エトキシ、 n －又は i －プロポキシで置換されていてもよいメチル、エチル、 n －又は i －プロピル、 n －、 i －又は s －ブチルを表すか、それぞれ場合によりシアノ、弗素、塩素又は臭素で置換されていてもよいプロベニル、ブテニル、プロピニル又はブチニルを表すか、それぞれ場合によりシアノ、弗素、塩素、臭素、メチル、エチル、 n －又は i －プロピルで置換されていてもよいシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルを表すか、又は場合によりニトロ、シアノ、弗素、塩素、臭素、メチル、エチル、 n －又は i －プロピル、 n －、 i －、 s －又は t －ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、 n －又は i －プロポキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシで置換されていてもよいフェニルを表すか、又は R^{32} と一緒になってそれぞれ場合によりメチル又はエチルで置換されていてもよいブタン-1，4-ジイル（トリメチレン）、ペンタン-1，5-ジイル、1-オキサブタン-1，4-ジイル又は3-オキサペンタン-1，5-ジイルを表す。

30

【0083】

X^4 は、好ましくは、ニトロ、シアノ、カルボキシル、カルバモイル、ホルミル、スルファモイル、ヒドロキシル、アミノ、弗素、塩素、臭素、メチル、エチル、 n －又は i －プロピル、 n －、 i －、 s －又は t －ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、 n －又は i －プロポキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシを表す。

40

【0084】

X^5 は、好ましくは、ニトロ、シアノ、カルボキシル、カルバモイル、ホルミル、スルファモイル、ヒドロキシル、アミノ、弗素、塩素、臭素、メチル、エチル、 n －又は i －プロピル、 n －、 i －、 s －又は t －ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、 n －又は i －プロポキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシを表す。

【0085】

本発明の除草剤薬害軽減剤として極めて特に好ましい式 (I Ia) の化合物の例を、以

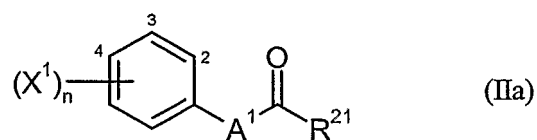
50

下の表 3 に示す。

【 0 0 8 6 】

【表 3】

表 3 : 式 (I I a) の化合物の例

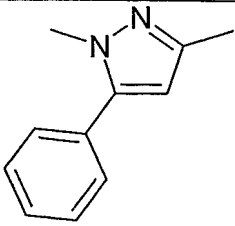
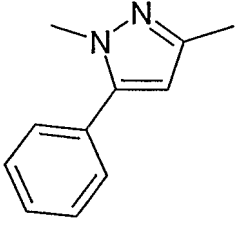
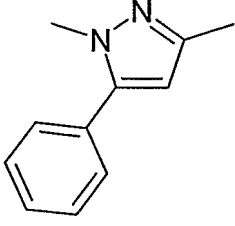
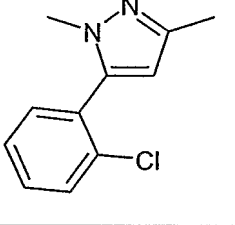
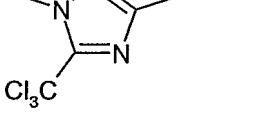
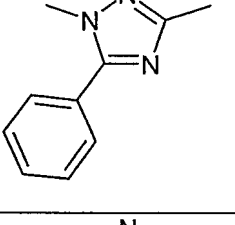
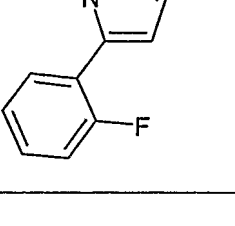


実施例 番号	(位置) (X¹) _n	A¹	R²¹
IIa-1	(2) Cl, (4) Cl		OCH₃
IIa-2	(2) Cl, (4) Cl		OCH₃
IIa-3	(2) Cl, (4) Cl		OC₂H₅
IIa-4	(2) Cl, (4) Cl		OC₂H₅

10

20

30

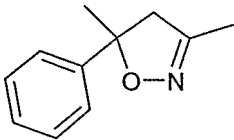
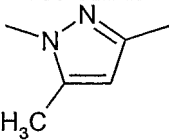
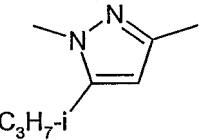
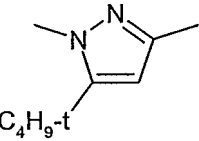
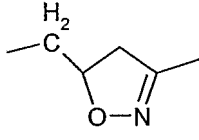
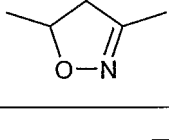
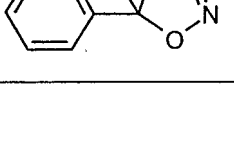
実施例 番号	(位置) (X ¹) _n	A ¹	R ²¹
IIa-5	(2) Cl		OCH ₃
IIa-6	(2) Cl, (4) Cl		OCH ₃
IIa-7	(2) F		OCH ₃
IIa-8	(2) F		OCH ₃
IIa-9	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-10	(2) Cl, (4) CF ₃		OCH ₃
IIa-11	(2) Cl		OCH ₃

10

20

30

40

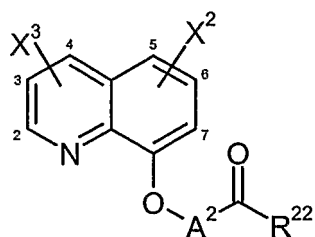
実施例 番号	(位置) (X ¹) _n	A ¹	R ²¹
IIa-12	-		OC ₂ H ₅
IIa-13	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-14	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-15	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-16	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-17	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-18	-		OH

【 0 0 8 7 】

本発明の除草剤薬害軽減剤として極めて特に好ましい式 (I I b) の化合物の例を、以下の表 4 に示す。

【 0 0 8 8 】

【表 4】



(IIb)

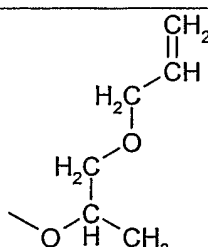
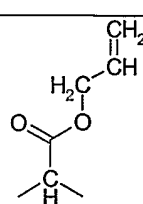
10

20

30

40

表4： 式 (I I b) の化合物の例

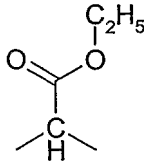
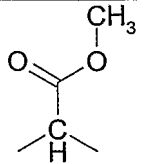
実施例 番号	(位置) X^2	(位置) X^3	A^2	R^{22}
IIb-1	(5) Cl	-	CH_2	OH
IIb-2	(5) Cl	-	CH_2	OCH_3
IIb-3	(5) Cl	-	CH_2	OC_2H_5
IIb-4	(5) Cl	-	CH_2	OC_3H_7-n
IIb-5	(5) Cl	-	CH_2	OC_3H_7-i
IIb-6	(5) Cl	-	CH_2	OC_4H_9-n
IIb-7	(5) Cl	-	CH_2	$OCH(CH_3)C_3H_{11-n}$
IIb-8	(5) Cl	(2) F	CH_2	OH
IIb-9	(5) Cl	(2) Cl	CH_2	OH
IIb-10	(5) Cl	-	CH_2	$OCH_2CH=CH_2$
IIb-11	(5) Cl	-	CH_2	OC_4H_9-i
IIb-12	(5) Cl	-	CH_2	
IIb-13	(5) Cl	-		$OCH_2CH=CH_2$

10

20

30

40

実施例 番号	(位置) X^2	(位置) X^3	A^2	R^{22}
IIb-14	(5) Cl	-		OC_2H_5
IIb-15	(5) Cl	-		OCH_3

10

【0089】

本発明の除草剤薬害軽減剤として極めて特に好ましい式 (I I c) の化合物の例を、以下の表 5 に示す。

【0090】

【表 5】

20

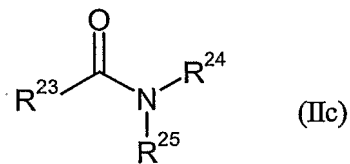
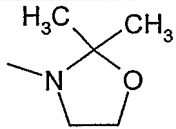
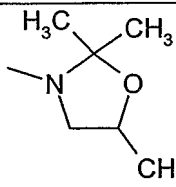
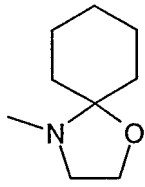
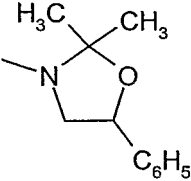
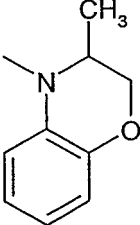
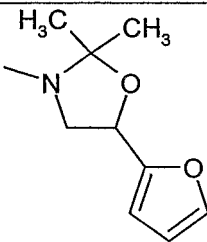


表 5 : 式 (I I c) の化合物の例

実施例 番号	R^{23}	$N(R^{24}, R^{25})$
IIc-1	$CHCl_2$	$N(CH_2CH=CH_2)_2$
IIc-2	$CHCl_2$	
IIc-3	$CHCl_2$	
IIc-4	$CHCl_2$	

30

40

実施例 番号	R^{23}	$N(R^{24}, R^{25})$
IIc-5	$CHCl_2$	
IIc-6	$CHCl_2$	
IIc-7	$CHCl_2$	

10

20

【0091】

本発明の除草剤薬害軽減剤として極めて特に好ましい式（II d）の化合物の例を、以下の表6に示す。

【0092】

【表6】

30

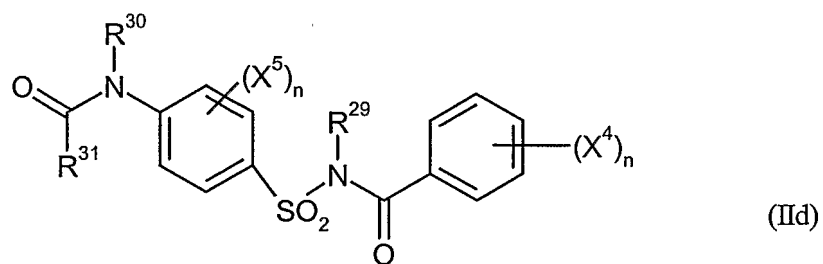


表6： 式（II d）の化合物の例

40

実施例 番号	R^{29}	R^{30}	R^{31}	(位置) $(X^4)_n$	(位置) $(X^5)_n$
II d-1	H	H	CH_3	(2) OCH_3	-
II d-2	H	H	C_2H_5	(2) OCH_3	-
II d-3	H	H	C_3H_7-n	(2) OCH_3	-
II d-4	H	H	C_3H_7-i	(2) OCH_3	-

50

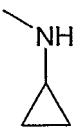
実施例 番号	R ²⁹	R ³⁰	R ³¹	(位置) (X ⁴) _n	(位置) (X ⁵) _n
IIId-5	H	H		(2) OCH ₃	-
IIId-6	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIId-7	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIId-8	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIId-9	H	H	C ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIId-10	H	H		(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIId-11	H	H	OCH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIId-12	H	H	OC ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIId-13	H	H	OC ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIId-14	H	H	SCH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIId-15	H	H	SC ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIId-16	H	H	SC ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIId-17	H	H	NHCH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIId-18	H	H	NHC ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIId-19	H	H	NHC ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-

10

20

30

40

実施例 番号	R ²⁹	R ³⁰	R ³¹	(位置) (X ⁴) _n	(位置) (X ⁵) _n
II d-20	H	H		(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
II d-21	H	H	NHCH ₃	(2) OCH ₃	-
II d-22	H	H	NHC ₃ H ₇ -i	(2) OCH ₃	-
II d-23	H	H	N(CH ₃) ₂	(2) OCH ₃	-
II d-24	H	H	N(CH ₃) ₂	(3) CH ₃ (4) CH ₃	-
II d-25	H	H	CH ₂ -O-CH ₃	(2) OCH ₃	-

【0093】

本発明の除草剤薬害軽減剤として極めて特に好ましい式 (I I e) の化合物の例を、以下の表 7 に示す。

【0094】

【表 7】

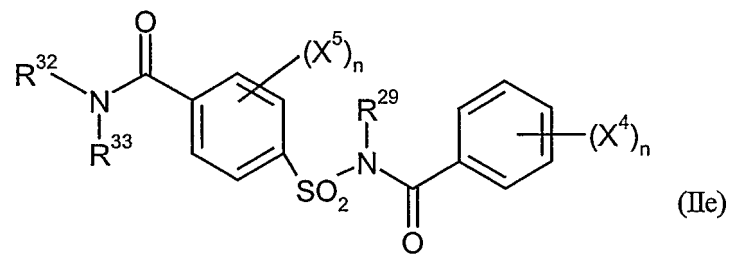


表 7 : 式 (I I e) の化合物の例

実施例番号	R ²⁹	R ³²	R ³³	(位置) (X ⁴) _n	(位置) (X ⁵) _n
II e-1	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃	-
II e-2	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃	-
II e-3	H	H	C ₃ H ₇ -n	(2) OCH ₃	-
II e-4	H	H	C ₃ H ₇ -i	(2) OCH ₃	-
II e-5	H	H		(2) OCH ₃	-
II e-6	H	CH ₃	CH ₃	(2) OCH ₃	-
II e-7	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-

実施例番号	R ²⁹	R ³²	R ³³	(位置) (X ⁴) _n	(位置) (X ⁵) _n
IIe-8	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIe-9	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIe-10	H	H	C ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIe-11	H	H		(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IIe-12	H	CH ₃	CH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-

10

【0095】

作物植物適合性改善化合物〔成分(b')〕として最も好ましいものは、クロキントセット・メキシル、フェンクロラゾール・エチル、イソキサジフェン・エチル、メフェンピル・ジエチル、フリラゾール、フェンクロリム、クミルロン、ダイムロン、ジメピベレート並びに化合物IIe-5及びIIe-11であり、特に重要なものはクロキントセット・メキシル及びメフェンピル・ジエチルである。

20

【0096】

本発明の薬害軽減剤として使用されるべき一般式(IIa)の化合物は、公知である及び／又はこれ自体公知の方法で製造することができる(国際公開第WO91/07874号、同WO95/07897号公報参照)。

【0097】

本発明の薬害軽減剤として使用されるべき一般式(IIb)の化合物は、公知である及び／又はこれ自体公知の方法で製造することができる(欧州特許出願公開第191736号公報参照)。

30

【0098】

本発明の薬害軽減剤として使用されるべき一般式(IIc)の化合物は、公知である及び／又はこれ自体公知の方法で製造することができる(ドイツ特許出願公開第2218097号、同第2350547号公報参照)。

【0099】

本発明の薬害軽減剤として使用されるべき一般式(IId)の化合物は、公知である及び／又はこれ自体公知の方法で製造することができる(ドイツ特許出願公開第19621522号公報／米国特許第6235680号公報参照)。

40

【0100】

本発明の薬害軽減剤として使用されるべき一般式(IIe)の化合物は、公知である及び／又はこれ自体公知の方法で製造することができる(国際公開第WO99/66795号／米国特許第6251827号公報参照)。

【0101】

それぞれ前記の式(I)の一つの活性化合物と一つの薬害軽減剤からなる本発明の選択性除草剤の組み合わせの例を、以下の表8に示す。

【0102】

【表 8】

表 8: 本発明の組み合わせの例

式(I)の活性化合物	薬害軽減剤
I-a	クロキントセツト・メキシル
I-a	フェンクロラゾール・エチル
I-a	イソキサゾフェン・エチル
I-a	メフェンピール・ジエチル
I-a	フリラゾール
I-a	フェンクロリム
I-a	クミルロン
I-a	タタイムロン
I-a	ジメヒペレート
I-a	IIe-11
I-a	IIe-5
I-b	クロキントセツト・メキシル
I-b	フェンクロラゾール・エチル
I-b	イソキサゾフェン・エチル
I-b	メフェンピール・ジエチル
I-b	フリラゾール
I-b	フェンクロリム
I-b	クミルロン
I-b	タタイムロン
I-b	ジメヒペレート
I-b	IIe-11
I-b	IIe-5
I-c	クロキントセツト・メキシル
I-c	フェンクロラゾール・エチル
I-c	イソキサゾフェン・エチル
I-c	メフェンピール・ジエチル
I-c	フリラゾール
I-c	フェンクロリム
I-c	クミルロン
I-c	タタイムロン
I-c	ジメヒペレート
I-c	IIe-5

10

20

30

40

式(I)の活性化合物	薬害軽減剤
I-c	Ile-11
I-d	クロキントセツ・メキシル
I-d	フェンクロラゾール・エチル
I-d	イソキサゾフェン・エチル
I-d	メフェンピール・ジエチル
I-d	フリラゾール
I-d	フェンクロリム
I-d	クミロン
I-d	タイルロン
I-d	ジメピペレート
I-d	Ile-11
I-d	Ile-5
I-e	クロキントセツ・メキシル
I-e	フェンクロラゾール・エチル
I-e	イソキサゾフェン・エチル
I-e	メフェンピール・ジエチル
I-e	フリラゾール
I-e	フェンクロリム
I-e	クミロン
I-e	タイルロン
I-e	ジメピペレート
I-e	Ile-5
I-e	Ile-11
I-f	クロキントセツ・メキシル
I-f	フェンクロラゾール・エチル
I-f	イソキサゾフェン・エチル
I-f	メフェンピール・ジエチル
I-f	フリラゾール
I-f	フェンクロリム
I-f	クミロン
I-f	タイルロン
I-f	ジメピペレート
I-f	Ile-5
I-f	Ile-11

10

20

30

40

式(I)の活性化合物	薬害軽減剤
I-g	クロキントセツ・メシル
I-g	フェンクロラゾール・エチル
I-g	イソキサゾフェン・エチル
I-g	メフェンピール・ジエチル
I-g	アリラゾール
I-g	フェンクロリム
I-g	クミロン
I-g	タイムロン
I-g	ジメヒペレート
I-g	IIf-5
I-g	IIf-11

10

【0103】

意外にも、今般、一般式(I)の4-ビフェニルピラゾリジン-3,5-ジオン誘導体と、前記に挙げた群(b')から選択される薬害軽減剤(解毒剤)との前記の活性化合物の組合せが、有用植物と極めて良好な適合性を有すると同時に、特に高い除草活性を有し、しかも種々の作物、特に穀類(特にコムギ)ばかりではなく大豆、ジャガイモ、トウモロコシ及び稲において、雑草の選択的防除に使用できることが知見された。

20

【0104】

ここで、作物植物に対する除草剤の悪影響を中和することができる多数の公知の薬害軽減剤又は解毒剤の中で、これらは、特に、雑草に対する除草活性に悪影響を相当な程度まで及ぼすことなく4-ビフェニル置換-4-置換ピラゾリジン-3,5-ジオンの作物植物に対する悪影響をほぼ完全に補うのに適している特に前記に挙げた群(b')の化合物であることは意外であると認められるべきである。

【0105】

ここで、特に穀物植物、例えばコムギ、オオムギ及びライ麦ばかりではなく、トウモロコシ及び稲を作物植物として保護することに関して、群(b')の中から選択される特に好ましい及び最も好ましい併用成分の特に都合の良い効果が重視し得る。

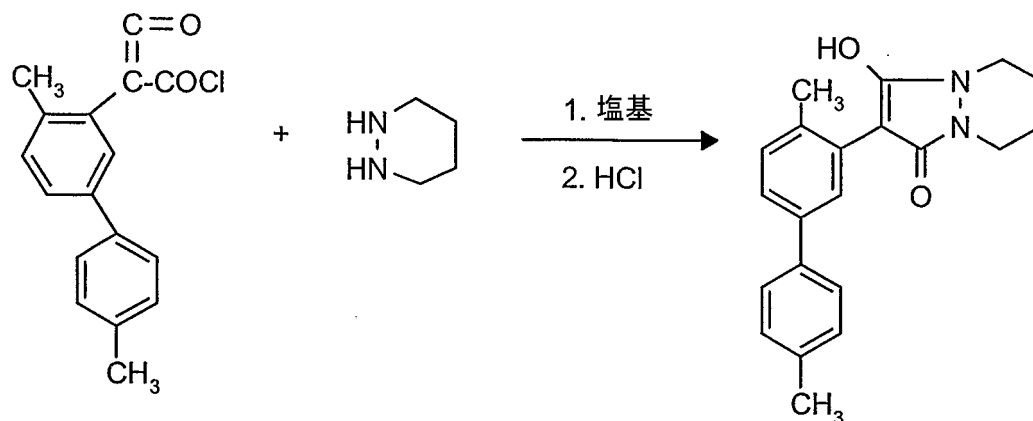
30

【0106】

例えば、方法(A-a)に従って、出発原料として(クロロカルボニル)3-[(6-メチル-3-(4-メチル)-フェニル)]フェニル]ケテンとヘキサヒドロピリダジンを使用すると、本発明の方法の経路は、下記の反応スキームで表すことができる：

【0107】

【化73】



40

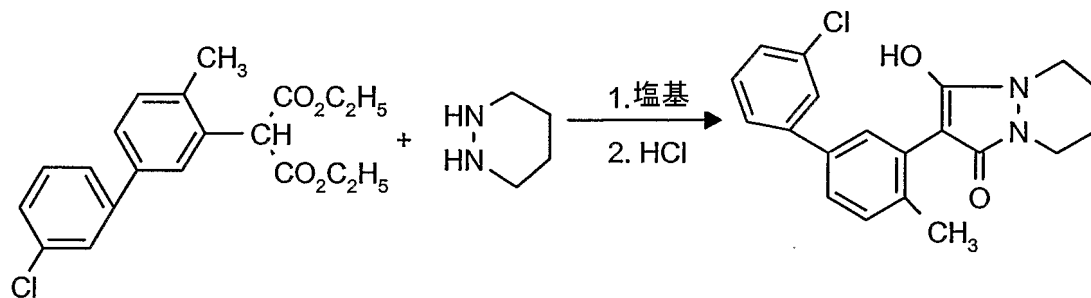
50

【0108】

例えば、方法（A-β）に従って、出発原料として3-〔6-メチル-3-（3-クロロフェニル）〕フェニルマロン酸ジエチルとヘキサヒドロピリダジンを使用すると、本発明の方法の経路は、下記の反応スキームで表すことができる：

【0109】

【化74】



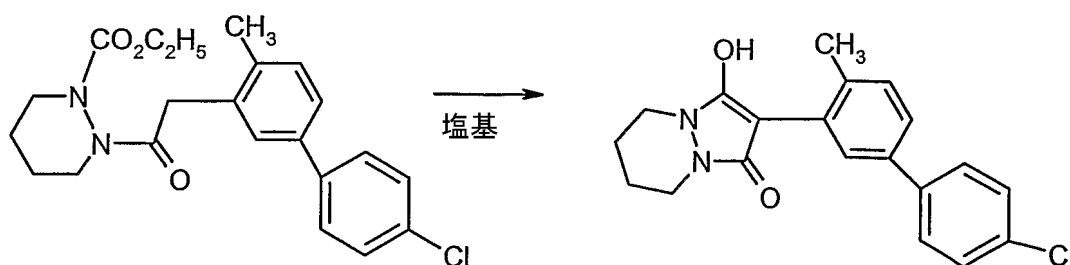
10

【0110】

例えば、方法（A-γ）に従って、出発原料として1-エトキシカルボニル-2-〔6-メチル-3-（4-クロロフェニル）フェニルアセチル〕ヘキサヒドロピリダジンを使用すると、この反応経路は、下記の反応スキームで表すことができる：

【0111】

【化75】



20

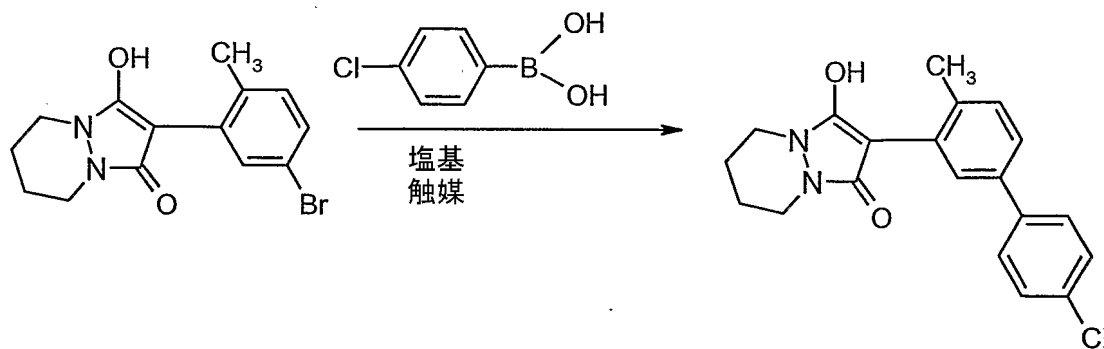
30

【0112】

方法（B）に従って、出発原料として8-〔3-ブromo-6-メチルフェニル〕-1,6-ジアザビシクロ〔4.3.0^{1.6}〕ノナン-7,9-ジオンと4-クロロフェニルボロン酸を使用すると、この反応の経路は、下記の反応スキームで表すことができる：

【0113】

【化76】



40

【0114】

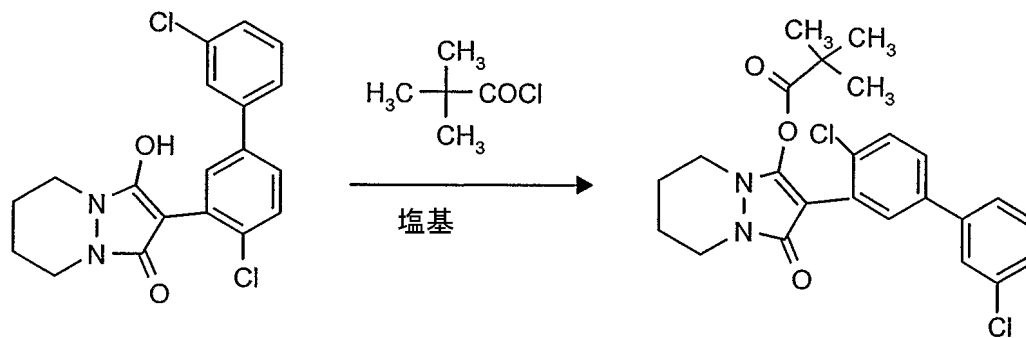
方法（Cα）に従って、出発原料として8-〔（2-クロロ-5-（3-クロロフェニル））フェニル〕-1,6-ジアザビシクロ〔4.3.0^{1.6}〕ノナン-7,9-ジオンとピバロイルクロリドを使用すると、本発明の方法の経路は、下記の反応スキームで表

50

すことができる：

【0115】

【化77】



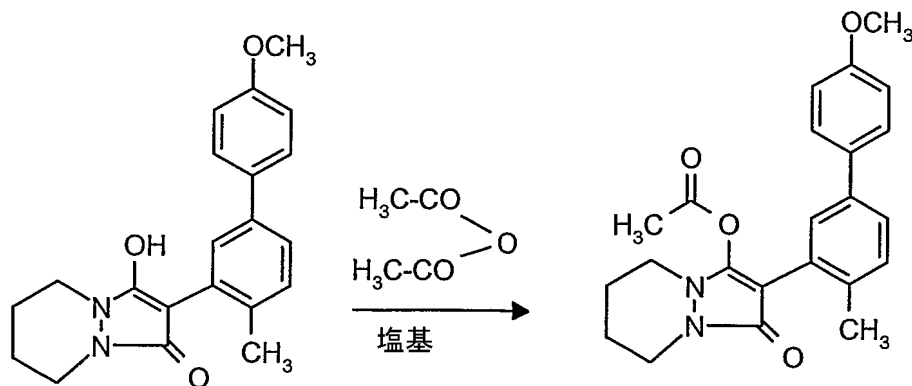
10

【0116】

方法(C) (変法β)に従って、出発原料として8-[(6-メチル-3-(4-メトキシフェニル)フェニル)-1,6-ジアザビシクロ[4.3.0]ノナン-7,9-ジオンと無水酢酸を使用すると、本発明の方法の経路は、下記の反応スキームで表すことができる：

【0117】

【化78】



20

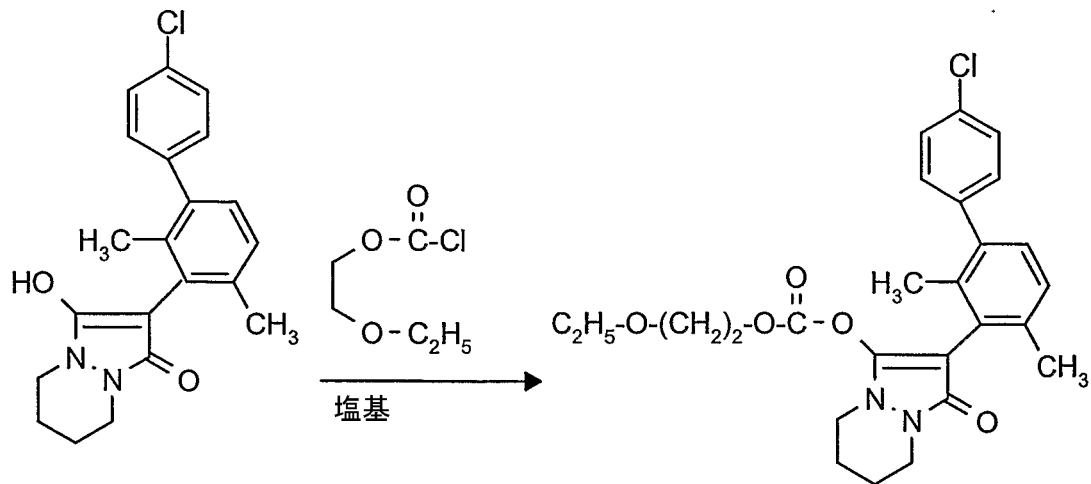
30

【0118】

方法(D)に従って、出発原料として8-[(2,6-ジメチル-3-(4-クロロフェニル)フェニル)-1,6-ジアザビシクロ[4.3.0]ノナン-7,9-ジオンとクロロギ酸エトキシエチルを使用すると、本発明の方法の経路は、下記の反応スキームで表すことができる：

【0119】

【化 7 9】



10

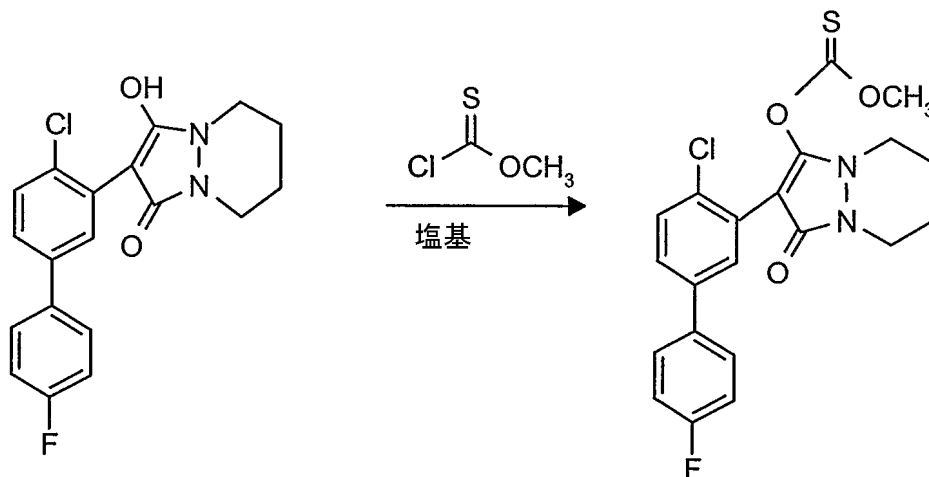
【0120】

方法 (E) に従って、出発原料として 8-[(2-クロロ-5-(4-フルオロフェニル)フェニル)-1,6-ジアザビシクロ[4.3.0]ノナン-7,9-ジオンとクロロモノチオギ酸メチルを使用すると、本発明の反応の経路は、下記の通り表すことができる：

20

【0121】

【化 8 0】



30

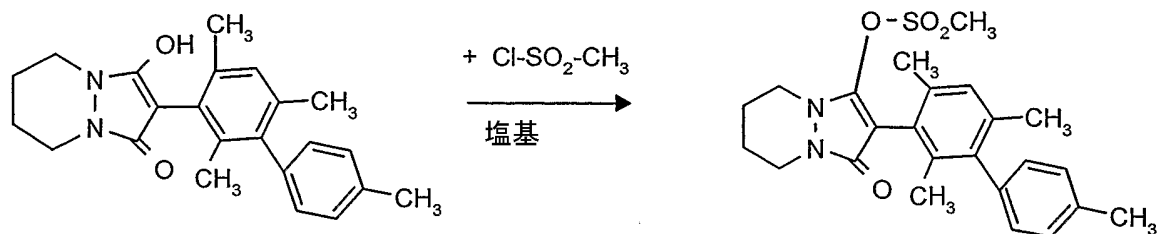
【0122】

方法 (F) に従って、出発原料として 8-[(2,4,6-トリメチル-3-(4-メチルフェニル)フェニル)-1,6-ジアザビシクロ[4.3.0]ノナン-7,9-ジオンとメタンスルホニルクロリドを使用すると、本発明の反応の経路は、下記の反応スキームで表すことができる：

40

【0123】

【化 8 1】



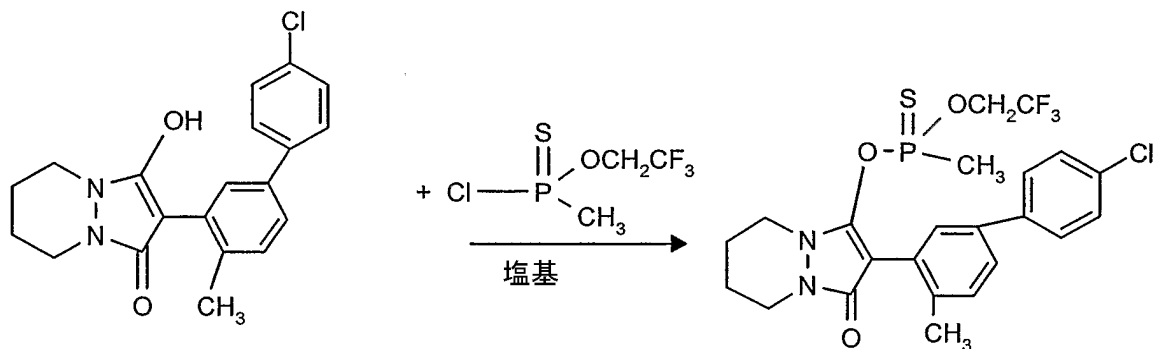
【0124】

10

方法 (G) に従って、出発原料として 8-[(6-メチル-3-(4-クロロフェニル)フェニル)-1,6-ジアザビシクロ[4.3.0^{1・6}]ノナン-7,9-ジオンと 2,2,2-トリフルオロエチルメタンチオホスホニルクロリドを使用すると、この反応の経路は、下記の反応スキームで表すことができる：

【0125】

【化 8 2】



20

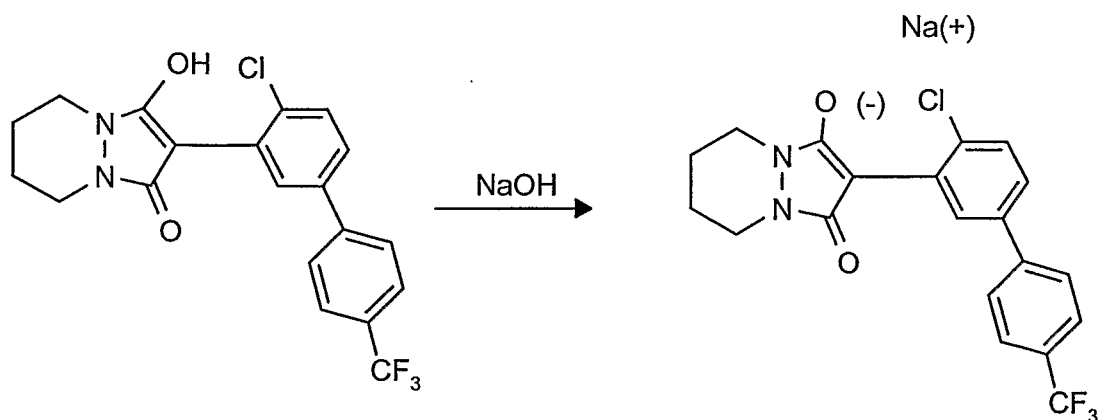
【0126】

方法 (H) に従って、成分として 8-[(2-クロロ-5-(4-トリフルオロメチルフェニル)フェニル)-1,6-ジアザビシクロ[4.3.0^{1・6}]ノナン-7,9-ジオンと NaOH を使用すると、本発明の方法の経路は、下記の反応スキームで表すことができる：

30

【0127】

【化 8 3】



40

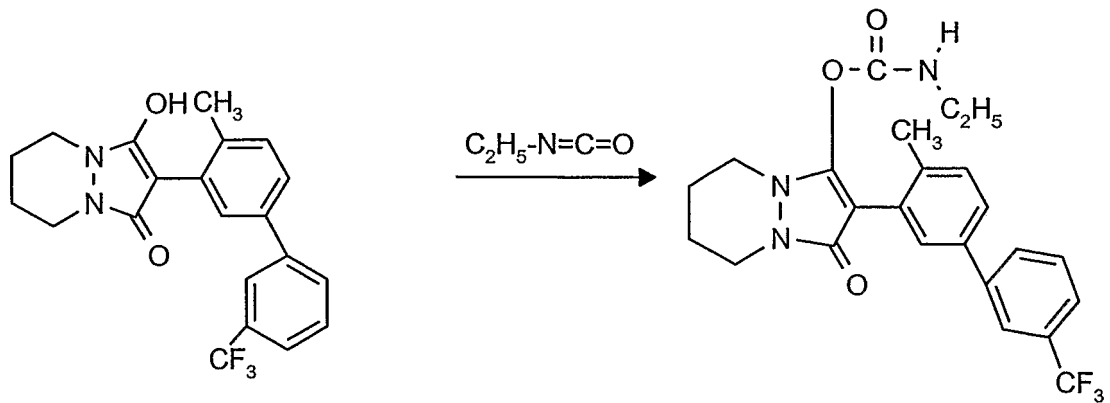
【0128】

方法 (I) (変法 α) に従って、出発原料として 8-[(6-メチル-3-(3-トリフルオロメチルフェニル)フェニル)-1,6-ジアザビシクロ[4.3.0^{1・6}]ノナン-7,9-ジオンとエチルイソシアネートを使用すると、この反応の経路は、下記の反応スキームで表すことができる：

50

【0129】

【化84】



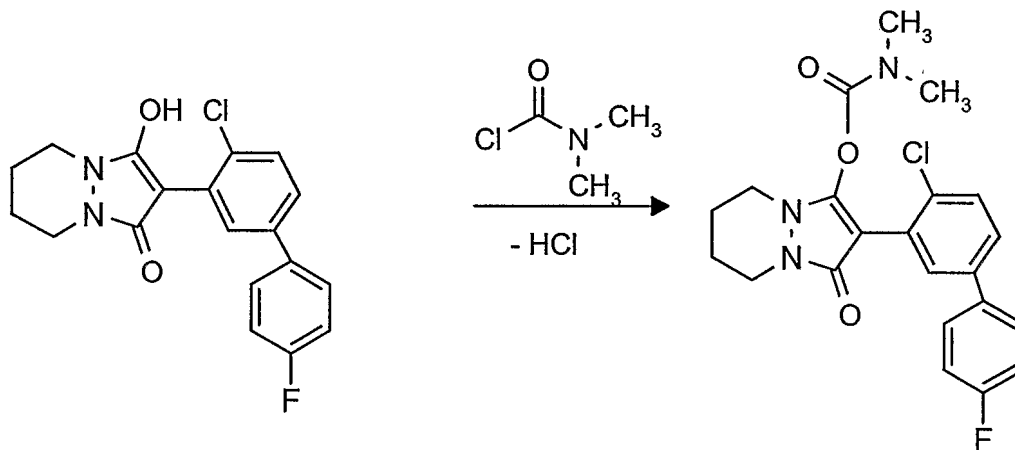
10

【0130】

方法（I）（変法β）に従って、出発原料として8-[(2-クロロ-5-(4-フルオロフェニル)フェニル)-1,6-ジアザビシクロ[4.3.0]^{1,6}ノナン-7,9-ジオンとジメチルカルバモイルクロリドを使用すると、この反応の経路は、下記の反応スキームで表すことができる：

【0131】

【化85】



20

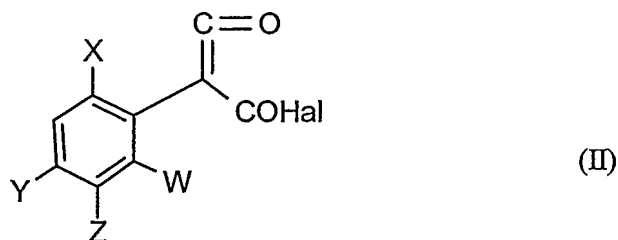
30

【0132】

前記の方法（A）（α）の出発原料として必要な式（II）のハロカルボニルケテンは、新規である。これらは、原則として公知の方法で製造することができる（例えば、Org. Prep. Proced. Int., (4), 155-158, 1975及びドイツ特許第1945703号公報参照）。従って、例えば、式（II）

【0133】

【化86】



(II)

（式中、W、X、Y及びZは前記で定義した通りであり及びHalは塩素又は臭素を表す）

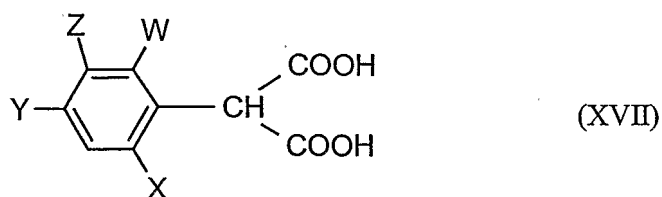
の化合物は、式（XVII）

40

50

【0134】

【化87】



(式中、W、X、Y及びZは前記で定義した通りである)

10

の置換フェニルマロン酸を、酸ハロゲン化物、例えば、塩化チオニル、塩化リン(V)、塩化リン(III)、塩化オキサリル、ホスゲン又は臭化チオニルと、適切ならば触媒、例えばジエチルホルムアミド、メチルステリルホルムアミド又はトリフェニルホスフィンの存在下で、及び適切ならば、塩基、例えばピリジン又はトリエチルアミンの存在下で反応させると得られる。

【0135】

式(XVII)の置換フェニルマロン酸は、新規である。これらは、公知の方法で簡単な方法で製造することができる(例えば、Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, p. 517 ff.、欧州特許出願公開第528156号、国際公開第97/36868号、同第WO97/01535号及び同第WO98/05638号公報参照)。

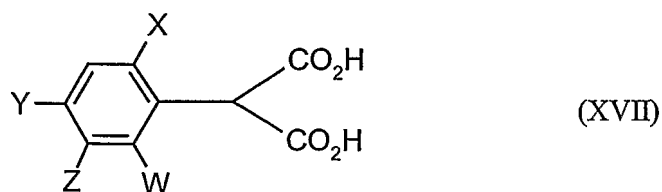
20

【0136】

従って、式(XVII)

【0137】

【化88】



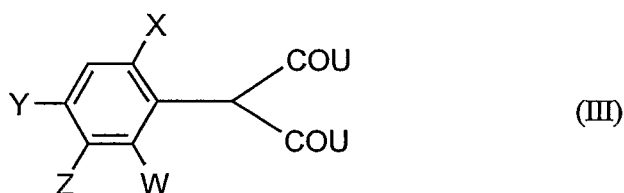
30

(式中、W、X、Y及びZは前記で定義した通りである)

のフェニルマロン酸は、式(III)

【0138】

【化89】



40

(式中、W、X、Y及びZは前記で定義した通りであり及びUはC₁ - C₈-アルコキシを表す)

のフェニルマロン酸エステルを、最初に塩基及び溶媒の存在下で加水分解し、次いで注意深く酸性化させると得られる(欧州特許出願公開第528156号、国際公開第WO97/36868号、同第WO97/01535号公報)。

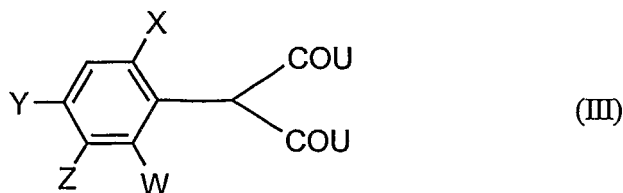
【0139】

式(III)

【0140】

50

【化 9 0】



(式中、W、X、Y及びZは前記で定義した通りであり及びUはC₁－C₈－アルコキシを表す)

10

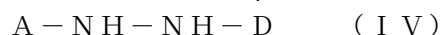
のマロン酸エステルは、新規である。

【0141】

これらは、有機化学の一般的に知られている方法（例えば、Tetrahedron Lett., 27, 2763 (1986)、Organikum VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, p. 587 ff.)で製造することができるし、また本発明の方法A(β)の出発原料としても使用できる。

【0142】

本発明の方法(A)(α)及び(A)(β)の出発原料として必要な式(IV)



20

(式中、A及びDは前記で定義した通りである)

のヒドラジン類の幾つかは公知であるし及び／又はこれらは文献から知られている方法で製造することができる〔例えば、Liebigs Ann. Chem., 585, 6 (1954); Reaktionen der organischen Synthese (Reaction of organic synthesis), C. Ferri, page 212, 513; Georg Thieme Verlag Stuttgart, 1978; Liebigs Ann. Chem., 443, 242 (1925); Chem. Ber., 98, 2551 (1965)、欧州特許出願公開第508126号、国際公開第WO92/16510号、同第WO99/47525号、同第WO01/17972号公報参照〕。

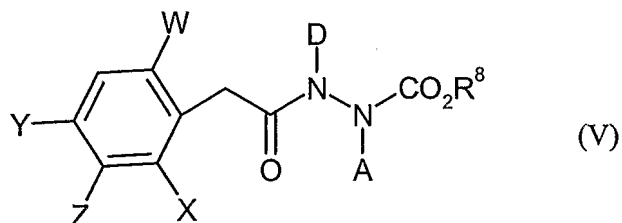
30

【0143】

本発明の方法A(γ)に必要な式(V)の化合物

【0144】

【化 9 1】



40

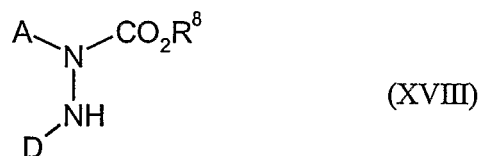
(式中、A、D、W、X、Y、Z及びR⁸は前記で定義した通りである)
の化合物は、新規である。

【0145】

前記の式(V)のカルバジン酸アシルは、例えば、式(XVII I)

【0146】

【化 9 2】

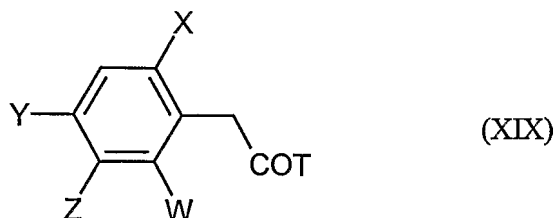


(式中、A、R⁸ 及び D は前記で定義した通りである)
 のカルバジン酸エステルを、式 (XIX)

【0147】

10

【化 9 3】



〔式中、

W、X、Y 及び Z は前記で定義した通りであり及び

20

T は、カルボン酸を活性化させるための試薬、例えばカルボニルジイミダゾール、カルボニルジイミド (例えば、ジシクロヘキシルカルボジイミド)、リン酸化剤 (例えば、POCl₃、BOP-Cl)、ハロゲン化剤、例えば塩化チオニル、塩化オキサリル、ホスゲン、スルホニルクロリド (例えば、トルエンスルホニルクロリド) 又はクロロギ酸エステルによって導入される脱離基を表す]

の置換フェニル酢酸誘導体を用いてアシル化すると得られる (Chem.

Reviews 52, 237-416 (1953); Bhattacharya, Indian J. Chem., 6, 341-5, 1968)。

【0148】

式 (XVII) のカルバジン酸エステルの幾つかは公知化合物であるし、又はこれらは原則的に公知の有機化学の方法で製造することができる。

30

【0149】

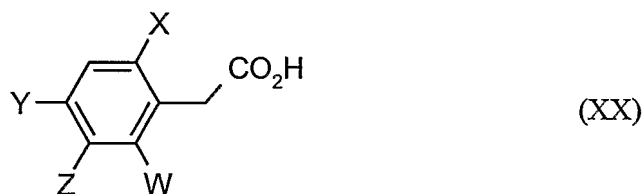
式 (XIV) の化合物の幾つかは新規であり又はこれらは原則として公知の方法、例えば国際公開第 WO 99/43649 号、同第 WO 99/48869 号、同第 WO 99/55673 号公報に記載の方法で製造することができる。

【0150】

式 (XIX) の化合物を製造するのに必要な式 (XX)

【0151】

【化 9 4】

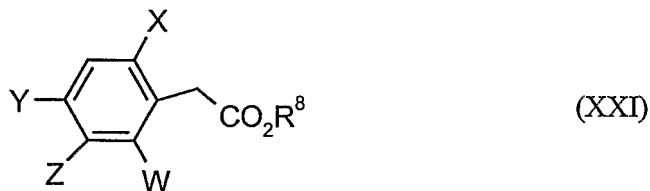


40

(式中、W、X 及び Y は前記で定義した通りである)
 のビフェニル酢酸は、例えば、式 (XXI)

【0152】

【化 9 5】



(式中、W、X、Y及びR⁸は前記で定義した通りである)
 のビフェニル酢酸エステルを、酸又は塩基の存在下で、溶媒の存在下で、一般に知られて
 いる公知の条件下で加水分解すると得られる。 10

【0153】

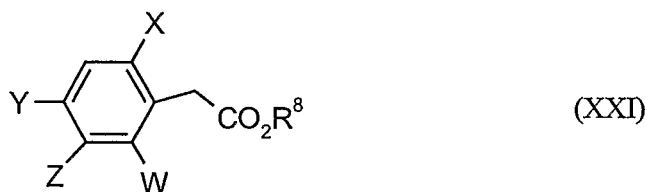
式(XX)及び(XXI)の化合物の幾つかは新規であり、国際公開第WO99/48
 869号公報に記載の方法と同様にして製造することができる。

【0154】

式(XXI)

【0155】

【化 9 6】

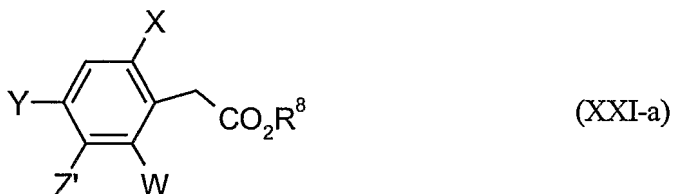


20

(式中、W、X、Y、Z及びR⁸は前記で定義した通りである)
 の化合物は、例えば、実施例に記載の方法(Q)によって、式(XXI-a)

【0156】

【化 9 7】



30

[式中、R⁸、W、X及びYは前記で定義した通りであり及びZ'はハロゲン(特に臭素)
)を表す]

のフェニル酢酸エステルを、式(VI)(式中、Zは前記で定義した通りである)のフェ
 ニルボロン酸の存在下で、塩基の存在下で及び適切ならば触媒〔好ましくは、パラジウム
 塩又はパラジウム錯体、例えばテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)
 〕の存在下で反応させると得られる。 40

【0157】

式(XXI-a)のフェニル酢酸エステル類の幾つかは、国際公開第WO97/015
 35号、同第WO97/36868号、同第WO98/05638号公報から知られてい
 るし、又はこれらは該公報に記載の方法で製造することができる。

【0158】

前記の方法(D)の出発原料として必要な式(I'-a)から(I'-g)(式中、A
 、D、W、X及びYは前記で定義した通りであり及びZ'は塩素又は臭素、好ましくは臭
 素を表す)の化合物の幾つかは公知である(国際公開第WO97/01535号、同第W
 O97/36868号、同第WO98/05638号、同第WO96/35664号、同 50

第WO97/02243号及び同第WO98/05638号公報)、又はこれらは該公報に記載の方法に従って製造することができる。

【0159】

式(VI)

【0160】

【化98】



10

(式中、Zは前記で定義した通りである)

のボロン酸の幾つかは、市販されているし、これらは一般的に知られている方法により簡単な方法で製造することができる。

【0161】

また、本発明の方法(C)、(D)、(E)、(F)、(G)、(H)及び(I)を実施するための出発原料として必要な式(VII)の酸ハロゲン化物、式(VIII)の無水カルボン酸、式(IX)のクロロギ酸エステル又はクロロギ酸チオエステル、式(X)のクロロモノチオギ酸エステル又はクロロジチオギ酸エステル、式(XI)のスルホニルクロリド、式(XII)のリン化合物並びにそれぞれ式(XIII)及び(XIV)の金属水酸化物、金属アルコキシド又はアミン並びに式(XV)のイソシアネート及び式(XVI)のカルバモイルクロリドは、有機又は無機化学の一般的に知られている化合物である。

20

【0162】

本発明の方法(A-α)は、式(IV)のヒドラジン又はこれらの化合物の塩を、式(II)のケテン酸ハロゲン化物と、希釈剤の存在下で及び適切ならば酸受容体の存在下で反応させることを特徴とする。

【0163】

本発明の方法(A-α)で使用するのに適した希釈剤は、全ての不活性有機溶媒である。場合により塩素化されていてもよい炭化水素、例えばメシチレン、クロロベンゼン及びジクロロベンゼン、トルエン、キシレン、またエーテル類、例えばジブチルエーテル、グリコールジメチルエーテル、ジグリコールジメチルエーテル及びジフェニルエーテル、さらにまた極性溶媒、例えばジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルホルムアミド又はN-メチルピロリドンを使用することが好ましい。

30

【0164】

本発明の方法の変法(A-α)を実施するのに適した酸受容体として使用するのに適切なものは、全ての慣用の酸受容体である。

【0165】

三級アミン、例えばトリエチルアミン、ピリジン、ジアザビスクロオクタン(DABCO)、ジアザビスクロウンデカン(DBU)、ジアザビスクロノネン(DBN)、ヒューニツヒ塩基及びN,N-ジメチルアニリンを使用することが好ましい。

40

【0166】

本発明の方法の変法(A-α)を実施する場合、反応温度は比較的広い範囲の中で変化させることができる。便宜上、この方法は0℃から250℃、好ましくは50℃から220℃の間の温度で実施される。

【0167】

本発明の方法(A-α)は、便宜上、常圧下で実施される。

【0168】

本発明の方法(A-α)を実施する場合、式(III)及び(IV)(式中、A、D、W、X、Y及びZは前記で定義した通りであり及びHe1はハロゲンを表す)の反応成分及び適切な場合には酸受容体は、一般にほぼ等モル量で使用される。しかし、一方の成分

50

又は他方の成分を比較的大過剰（最大で5モル）で使用することもできる。

【0169】

本発明の方法（A-β）は、式（I V）のヒドラジン又はこの化合物の塩（式中、A及びDは前記で定義した通りである）を、塩基の存在下で、式（I I I）（式中、U、W、X、Y及びZは前記で定義した通りである）のマロン酸エステル又はマロンアミドとの縮合反応に供することを特徴とする。

【0170】

本発明の方法（A-β）で使用するに適した希釈剤は、全ての不活性有機溶媒である。場合によりハロゲン化されていてもよい炭化水素、例えばトルエン、キシレン、メシチレン、クロロベンゼン及びジクロロベンゼン、またエーテル類、例えばジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジフェニルエーテル、グリコールジメチルエーテル及びジグリコールジメチルエーテル、さらにまた極性溶媒、例えばジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド及びN-メチルピロリドン、並びにアルコール類、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール、イソブタノール及びtert-ブタノールを使用することが好ましい。

【0171】

本発明の方法（A-β）を実施するのに適した塩基（脱プロトン化剤）は、全ての慣用のプロトン受容体である。アルカリ金属及びアルカリ土類金属の酸化物、水酸化物及び炭酸塩、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、酸化マグネシウム、酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム及び炭酸カルシウムを使用することが好ましく、これらは相間移動触媒、例えば、トリエチルベンジルアンモニウムクロリド、テトラブチルアンモニウムブロミド、Adogen 464 [=メチルトリ（C₈-C₁₀-アルキル）アンモニウムクロリド] 又はTDA 1 [=トリス（メトキシエトキシエチル）アミン] の存在下で使用することもできる。また、アルカリ金属、例えばナトリウム又はカリウムを使用することもできる。さらにまた、アルカリ金属及びアルカリ土類金属のアミド及び水素化物、例えばナトリウムアミド、水素化ナトリウム及び水素化カルシウム、さらにまたアルカリ金属アルコキシド、例えばナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド及びカリウムtert-ブトキシドを使用することもできる。

【0172】

三級アミン、例えばトリエチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロオクタン（DABCO）、ジアザビシクロウンデカン（DBU）、ジアザビシクロノネン（DBN）、ヒューニッヒ塩基及びN,N-ジメチルアニリンを使用することもできる。

【0173】

本発明の方法（A-β）を実施する場合、反応温度は比較的に広い範囲の中で変化させることができる。一般に、この方法は0℃から280℃、好ましくは50℃から180℃の温度で実施される。

【0174】

本発明の方法（A-β）は、一般に常圧下で実施される。

【0175】

本発明の方法（A-β）を実施する場合、式（I I I）及び（I V）の反応成分は、一般にほぼ等モル量で使用される。しかし、一方の成分又は他方の成分を比較的大過剰（最大で3モル）で使用することもできる。

【0176】

本発明の方法（A-γ）では、式（V）（式中、A、D、W、X、Y、Z及びR⁸は前記で定義した通りである）の化合物を、塩基の存在下で分子内縮合反応に供することを特徴とする。

【0177】

本発明の方法（A-γ）で使用するのに適した希釈剤は、全ての不活性有機溶媒である。炭化水素、例えばトルエン及びキシレン、またエーテル類、例えばジブチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、グリコールジメチルエーテル及びジグリコールジメチ

ルエーテル、さらにまた極性溶媒、例えばジメチルスルホキシド、スルホラン、ジメチルホルムアミド及びN-メチルピロリドン、並びにアルコール類、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール、イソブタノール及びtert-ブタノールを使用することが好ましい。

【0178】

本発明の方法(A-γ)を実施するのに適した塩基(脱プロトン化剤)は、全ての慣用のプロトン受容体である。アルカリ金属及びアルカリ土類金属の酸化物、水酸化物及び炭酸塩、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、酸化マグネシウム、酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム及び炭酸カルシウムを使用することが好ましく、これらは相間移動触媒、例えば、トリエチルベンジルアンモニウムクロリド、テトラブチルアンモニウムブロミド、Adogen 464 [=メチルトリ(C₈-C₁₀-アルキル)アンモニウムクロリド]又はTDA 1 [=トリス(メトキシエトキシエチル)アミン]の存在下で使用することもできる。さらにまた、アルカリ金属、例えばナトリウム又はカリウムを使用することもできる。また、アルカリ金属及びアルカリ土類金属のアミド及び水素化物、例えばナトリウムアミド、水素化ナトリウム及び水素化カルシウム、さらにまたアルカリ金属アルコキシド、例えばナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド及びカリウムtert-ブトキシドも適している。

10

【0179】

本発明の方法(A-γ)を実施する場合、反応温度は比較的広い範囲の中で変化させることができる。一般に、この反応は0℃から250℃、好ましくは50℃から150℃の間の温度で実施される。

20

【0180】

本発明の方法(A-γ)は、一般に常圧下で実施される。

【0181】

本発明の方法(A-γ)を実施する場合、式(V)の反応成分と脱プロトン化塩基は、一般にほぼ等モル量で使用される。しかし、一方の成分又は他方の成分を比較的大過剰(最大で3モル)で使用することもできる。

【0182】

本発明の方法(B)を実施するのに適した触媒は、パラジウム(0)錯体である。例えば、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムが好ましい。適切ならば、パラジウム(II)化合物、例えばPdCl₂を使用することも可能であり得る。

30

【0183】

本発明の方法(B)を実施するのに適した酸受容体は、無機又は有機塩基である。これらの塩基としては、好ましくはアルカリ土類金属又はアルカリ金属の水酸化物、酢酸塩、炭酸塩又は炭酸水素酸塩、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化バリウム又は水酸化アンモニウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウム又は酢酸アンモニウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム又は炭酸アンモニウム、炭酸水素ナトリウム又は炭酸水素カリウム、アルカリ金属弗素化物、例えば弗化セシウム、及び第三級アミン、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジメチルベンジルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、N-メチルモルホリン、N,N-ジメチルアミノピリジン、ジアザビスクロオクタン(DABCO)、ジアザビスクロノネン(DBN)又はジアザビスクロウンデセン(DBU)が挙げられる。

40

【0184】

本発明の方法(B)を実施するのに適した希釈剤は、水、有機溶媒及びこれらの混合物である。挙げ得る例は：脂肪族、脂環式又は芳香族炭化水素、例えば、石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレン又はデカリン；ハロゲン化炭化水素、例えばクロロベンゼン、ジクロロベンゼン、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、トリクロロエタン又はテトラクロロエチレン；エーテル類、例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチ

50

ル t-ブチルエーテル、メチル t-アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシメタン、1, 2-ジエトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテル又はアニソール；アルコール類、例えばメタノール、エタノール、n-又は i-プロパノール、n-, i s o -, s e c-又は t e r t-ブタノール、エタンジオール、プロパン-1, 2-ジオール、エトキシエタノール、メトキシエタノール、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル；水である。

【0185】

本発明の方法（B）の反応温度は、比較的広い範囲の中で変化させることができる。一般的に、反応は 0℃から +140℃、好ましくは 50℃から +100℃の間の温度で実施される。

10

【0186】

本発明の方法（B）を実施する場合、式（VI）（式中、Zは前記で定義した通りである）のボロン酸と、式（I'-a）から（I'-g）（式中、A、D、W、X、Y及びZ'は前記で定義した通りである）の化合物は、1：1から3：1、好ましくは1：1から2：1のモル比で使用される。一般的に、式（I'-a）から（I'-g）の化合物1モル当たり0.005から0.5モル、好ましくは0.01モルから0.1モルの触媒が使用される。塩基は、一般に過剰に使用される。

【0187】

本発明の方法（E-α）は、式（I-a）の化合物を、それぞれ式（VII）のカルボニルハライドと、適切ならば希釈剤の存在下で及び適切ならば酸結合剤の存在下で反応させることを特徴とする。

20

【0188】

本発明の方法（C-α）で使用するのに適した希釈剤は、酸ハロゲン化物に対して不活性である全ての溶媒である。炭化水素、例えばベンジン、ベンゼン、トルエン、キシレン及びテトラリン、またハロゲン化炭化水素、例えば塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、クロロベンゼン及びo-ジクロロベンゼン、さらにまたケトン類、例えばアセトン及びメチルイソプロピルケトン、さらにまたエーテル類、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサン、さらにまたカルボン酸エステル、例えば酢酸エチル、並びに強極性溶媒、例えばジメチルスルホキシド及びスルホランを使用することが好ましい。酸ハロゲン化物の加水分解安定性が許すならば、反応は水の存在下で実施することもできる。

30

【0189】

本発明の方法（C-α）の反応に適した酸結合剤は、全ての慣用の酸受容体である。三級アミン、例えばトリエチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロオクタン（DABCO）、ジアザビシクロウンデセン（DBU）、ジアザビシクロノネン（DBN）、ヒューニツヒ塩基及びN, N-ジメチルアニリン、またアルカリ土類金属酸化物、例えば酸化マグネシウム及び酸化カルシウム、さらにまたアルカリ金属及びアルカリ土類金属炭酸塩、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム及び炭酸カルシウム、並びにアルカリ金属水酸化物、例えば水酸化ナトリウム及び水酸化カリウムを使用することが好ましい。

【0190】

本発明の方法（C-α）の反応温度は、比較的広い範囲の中で変化させることができる。一般に、反応は-20℃から+150℃、好ましくは0℃から100℃の間の温度で実施される。

40

【0191】

本発明の方法（C-α）を実施する場合、式（I-a）の出発原料と式（VII）のカルボニルハライドは、一般にそれぞれほぼ等モル量で使用される。しかし、カルボニルハライドを比較的大過剰（最大で5モル）で使用することもできる。後処理は、慣用の方法で実施される。

【0192】

本発明の方法（C-β）は、式（Ia）の化合物を、式（VII I）の無水カルボン酸

50

と、適切ならば希釈剤の存在下で及び適切ならば酸結合剤の存在下で反応させることを特徴とする。

【0193】

本発明の方法（C-β）で使用するのに適した希釈剤は、酸ハロゲン化物を使用する場合にも好ましい希釈剤であることが好ましい。また、過剰の無水カルボン酸は、希釈剤として同時に作用し得る。

【0194】

適切ならば本発明の方法（C-β）で添加される酸結合剤は、酸ハロゲン化物を使用する場合にも好ましい酸結合剤であることが好ましい。

【0195】

本発明の方法（C-β）の反応温度は、比較的広い範囲の中で変化させることができる。一般に、反応は-20℃から+150℃、好ましくは0℃から100℃の間の温度で実施される。

【0196】

本発明の方法（C-β）を実施する場合、式（I a）の出発原料と式（V I I I）の無水カルボン酸は、一般にそれぞれほぼ等モル量で使用される。しかし、無水カルボン酸を比較的大過剰（最大で5モル）で使用することもできる。後処理は、慣用の方法で実施される。

【0197】

一般的に、希釈剤及び過剰の無水カルボン酸並びに生成したカルボン酸は、蒸留によって、又は有機溶媒又は水で洗浄することによって除去される。

【0198】

本発明の方法（D）は、式（I a）の化合物を、それぞれ式（I X）のクロロギ酸エステル又はクロロギ酸チオエステルと、適切ならば希釈剤の存在下で及び適切ならば酸結合剤の存在下で反応させることを特徴とする。

【0199】

本発明の方法（D）の反応に適した酸結合剤は、全て慣用の酸受容体である。三級アミン、例えばトリエチルアミン、ピリジン、D A B C O、D B U、D B A、ヒューニツヒ塩基及びN，N-ジメチルアニリン、またアルカリ土類金属酸化物、例えば酸化マグネシウム及び酸化カルシウム、さらにまたアルカリ金属及びアルカリ土類金属の炭酸塩、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム及び炭酸カルシウム、並びにアルカリ金属水酸化物、例えば水酸化ナトリウム及び水酸化カリウムを使用することが好ましい。

【0200】

本発明の方法（D）に適した希釈剤は、クロロギ酸エステル又はクロロギ酸チオエステルに対して不活性である全ての溶媒である。炭化水素、例えばベンジン、ベンゼン、トルエン、キシレン及びテトラリン、またハロゲン化炭化水素、例えば塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、クロロベンゼン及びo-ジクロロベンゼン、さらにまたケトン類、例えばアセトン及びメチルイソプロピルケトン、さらにまたエーテル類、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサン、さらにまたカルボン酸エステル、例えば酢酸エチル並びに強極性溶媒、例えばジメチルスルホキシド及びスルホランを使用することが好ましい。

【0201】

本発明の方法（D）を実施する場合、反応温度は比較的広い範囲の中で変化させることができる。この反応を希釈剤及び酸結合剤の存在下で実施する場合には、反応温度は一般に-20℃から+100℃、好ましくは0℃から50℃である。

【0202】

本発明の方法（D）は、一般に常圧下で実施される。

【0203】

本発明の方法（D）を実施する場合、式（I-a）の出発原料と式（I X）の適切なクロロギ酸エステル又はクロロギ酸チオエステルは、一般にそれぞれほぼ等モル量で使用さ

10

20

30

40

50

れる。しかし、一方の成分又は他方の成分を比較的大過剰（最大で2モル）で使用することもできる。後処理は慣用の方法で実施される。一般に、沈殿した塩が除去され、残る反応混合物は希釈剤を減圧下で除去することによって濃縮される。

【0204】

本発明の方法（E）は、式（I-a）の化合物を、それぞれ式（X）の化合物と、希釈剤の存在下で及び適切ならば酸結合剤の存在下で反応させることを特徴とする。

【0205】

製造方法（E）では、式（I-a）の出発原料1モル当たり、約1モルの式（X）のクロモノチオギ酸エステル又はクロロジチオギ酸エステルを0から120℃、好ましくは20から60℃で反応させる。

10

【0206】

適切ならば添加される適切な希釈剤は、全ての不活性極性有機溶媒、例えばエーテル類、アミド類、スルホン類、スルホキシド類、及びハロゲン化アルカンである。

【0207】

ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド又は塩化メチレンを使用することが好ましい。

【0208】

好ましい実施態様において、化合物（I-a）のエノラート塩は、強脱プロトン化剤、例えば水素化ナトリウム又はカリウムtert-ブトキシドを加えることによって製造され、さらなる酸結合剤の添加は無しで済ませ得る。

20

【0209】

酸結合剤を使用する場合には、これらの酸結合剤は、慣用の無機又は有機塩基、例えば、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、ピリジン、トリエチルアミンである。

【0210】

反応は、常圧又は加圧下で実施することができ、常圧で実施することが好ましい。後処理は、慣用の方法で実施される。

【0211】

本発明の方法（F）は、式（I-a）の化合物を、それぞれ式（XI）のスルホニルクロリドと、適切ならば希釈剤の存在下で及び適切ならば酸結合剤の存在下で反応させることを特徴とする。

30

【0212】

製造方法（F）では、式（I-a）の出発原料1モル当たり、約1モルの式（XI）のスルホニルクロリドを-20から150℃、好ましくは20から70℃で反応させる。

【0213】

適切ならば添加される適切な希釈剤は、全ての不活性極性有機溶媒、例えばエーテル類、アミド類、ニトリル類、スルホン類、スルホキシド類又はハロゲン化炭化水素、例えば塩化メチレンである。

【0214】

ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、塩化メチレンを使用することが好ましい。

40

【0215】

好ましい実施態様において、化合物（I-a）のエノラート塩は、強脱プロトン化剤（例えば、水素化ナトリウム又はカリウムtert-ブトキシド）を加えることによって製造され、さらなる酸結合剤の添加は無しで済ませ得る。

【0216】

酸結合剤を使用する場合には、これらの酸結合剤は、慣用の無機又は有機塩基、例えば、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、ピリジン、トリエチルアミンである。

【0217】

50

反応は、常圧又は加圧下で実施することができ、常圧で実施することが好ましい。後処理は、慣用の方法で実施される。

【0218】

本発明の方法（G）は、式（I-a）の化合物を、それぞれ式（XII）のリン化合物と、適切ならば希釈剤の存在下で及び適切ならば酸結合剤の存在下で反応させることを特徴とする。

【0219】

製造方法（G）では、式（I-e）の化合物を得るために、式（I-a）の化合物1モル当たり、1から2モル、好ましくは1から1.3モルの式（XII）のリン化合物を-40℃から150℃、好ましくは-10から110℃で反応させる。

10

【0220】

適切ならば添加される適切な希釈剤は、全ての不活性極性有機溶媒、例えばエーテル類、アミド類、ニトリル類、アルコール類、スルフィド類、スルホン類、スルホキシド類などである。

【0221】

アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、塩化メチレンを使用することが好ましい。

【0222】

適切ならば添加される適切な酸結合剤は、慣用の無機又は有機塩基、例えば水酸化物、炭酸塩又はアミン類である。挙げ得る例は、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、ピリジン、トリエチルアミンである。

20

【0223】

反応は、常圧又は加圧下で実施することができ、常圧下で実施することが好ましい。後処理は、有機化学の慣用の方法で実施される。得られる最終生成物の精製は、結晶化、クロマトグラフ精製によるか又は「初期蒸留」、すなわち揮発性成分を減圧下で除去することによることが好ましい。

【0224】

本発明の方法（H）は、式（I-a）の化合物を、式（XIII）の金属水酸化物又は金属アルコキシド、又は式（XIV）のアミンと、適切ならば希釈剤の存在下で反応させることを特徴とする。

30

【0225】

本発明の方法（H）で使用するのに適した希釈剤は、好ましくは、エーテル類、例えばテトラヒドロフラン、ジオキサン、ジエチルエーテル、又はアルコール類、例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、並びに水である。

【0226】

本発明の方法（H）は、一般に常圧下で実施される。

【0227】

反応温度は、一般的には-20℃から100℃、好ましくは0℃から50℃である。

【0228】

本発明の方法（I）は、式（I-a）の化合物を、それぞれ式（XV）の化合物と適切ならば希釈剤の存在下で及び適切ならば触媒の存在下で反応させる（I-α）か、又は式（XVI）の化合物と適切ならば希釈剤の存在下で及び適切ならば酸結合剤の存在下で反応させる（I-β）ことを特徴とする。

40

【0229】

製造方法（I-α）では、式（I-a）の出発原料1モル当たり、約1モルの式（XV）のイソシアネートを0から100℃、好ましくは20から50℃で反応させる。

【0230】

適切ならば添加される適切な希釈剤は、全ての不活性有機溶媒、例えばエーテル類、アミド類、ニトリル類、スルホン類、スルホキシド類である。

【0231】

50

適切ならば、触媒を、反応を促進させるために添加してもよい。触媒として使用するのに適したものは、有機スズ化合物、例えば、ジブチル錫ジラウレートであることが極めて都合がよい。反応は常圧下で実施することが好ましい。

【0232】

製造方法 (I-β) では、式 (I-a) の出発原料 1 モル当たり、約 1 モルの式 (XVI) のカルバモイルクロリドを -20 から 150℃、好ましくは 0 から 70℃ で反応させる。

【0233】

適切ならば添加される適切な希釈剤は、全ての不活性極性有機溶媒、例えばエーテル類、アミド類、スルホン類、スルホキシド類又はハロゲン化炭化水素である。

10

【0234】

ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド又は塩化メチレンを使用することが好ましい。

【0235】

好ましい実施態様において、化合物 (I-a) のエノラート塩が強脱プロトン化剤 (例えば、水素化ナトリウム又はカリウム *tert*-ブトキシド) を加えることによって製造される場合には、さらなる酸結合剤の添加は無しで済ませ得る。

【0236】

酸結合剤を使用する場合には、これらの酸結合剤は、慣用の無機又は有機塩基、例えば、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、トリエチルアミン又はピリジンである。

20

【0237】

反応は、常圧又は加圧下で実施することができ、常圧下で実施することが好ましい。後処理は、慣用の方法で実施される。

【0238】

本発明の活性化合物は、植物に十分に許容され、都合の良い恒温動物毒性を有し及び環境に優しい；本発明の活性化合物は、植物及び植物器官の保護、収穫量の増大、収穫物の品質の向上に適し、また農業、林業、庭園及びレジャー施設、貯蔵製品及び材料の保護並びに衛生部門において遭遇する動物害虫、特に昆虫、クモ形動物及び線虫の防除に適している。本発明の活性化合物は、好ましくは作物保護剤として使用される。本発明の活性化合物は、通常感受性及び抵抗性の種に対して並びに発育段階の全部又は幾つかに対して活性である。前記の害虫としては、下記のもの挙げられる：

30

等脚目 (*Isopoda*) から、例えばオニスクス・アセルス (*Oniscus asellus*)、オカダンゴムシ (*Armadillidium vulgare*) 及びワラジムシ (*Porcellio scaber*)、

ヤスデ綱 (*Diplopoda*) から、例えばブラニウルス・グッツラーツ (*Blaniulus guttulatus*)、

ムカデ綱 (*Chilopoda*) から、例えばツチムカデ (*Geophilus carpophagus*) 及びスクチゲラ (*Scutigera*) 種、

コムカデ目 (*Symphyla*) から、例えばスクチゲラ・イマクラータ (*Scutigerebella immaculata*)、

40

シミ目 (*Thysanura*) から、例えばセイヨウシミ (*Lepisma saccharina*)、

トビムシ目 (*Collembola*) から、例えばシロトビムシ (*Onychiurus armatus*)、

直翅目 (*Orthoptera*) から、例えばヨーロッパイエコオロギ (*Achetia domestica*)、ケラ (*Gryllotalpa*) 種、トノサマバッタ (*Locusta migratoria migratorioides*)、メラノプルス (*Melanoplus*) 種及びサバクトビバッタ (*Schistocerca gregaria*)、

50

ゴキブリ目 (Blattaria) から、例えばトウヨウゴキブリ (Blatta orientalis)、ワモンゴキブリ (Periplaneta americana)、マデラゴキブリ (Leucophaea maderae) 及びチャバネゴキブリ (Blattella germanica)、

ハサミムシ目 (Dermaptera) から、例えば、ヨーロッパクギヌキハサミムシ (Forficula auricularia)、

シロアリ目 (Isoptera) から、例えばヤマトシロアリ (Reticulitermes) 種、

シラミ (Phthiraptera) 目から、例えばコロモジラミ (Pediculus humanus corporis)、ブタジラミ (Haematopinus) 種、ケモノジラミ (Linognathus) 種、ケモノハジラミ (Trichodectes) 種及びハジラミ (Damalinia) 種、

総翅目 (Thysanoptera) から、例えばクリバネアザミウマ (Hercinothrips femoralis)、ネギアザミウマ (Thrips tabaci)、ミナミキイロアザミウマ (Thrips palmi) 及びミカンキイロアザミウマ (Frankliniella occidentalis)、

異翅目 (Heteroptera) から、例えばチャイロカメムシ (Eurygaster) 種、ベニホシカメムシ (Dysdercus intermedius)、ピエスマ・クアドゥラータ (Piesma quadrata)、トコジラミ (Cimex lectularius)、オオサシガメ (Rhodnius prolixus) 及びサシガメ (Triatoma) 種、

同翅目 (Homoptera) から、例えばアレウロデス・ブラシッカエ (Aleurodes brassicae)、タバココナジラミ (Bemisia tabaci)、オンシツコナジラミ (Trialeurodes vaporariorum)、ワタアブラムシ (Aphis gossypii)、ダイコンアブラムシ (Brevicoryne brassicae)、クリプトミズス・リビス (Cryptomyzus ribis)、マメノクロアブラムシ (Aphis fabae)、アフィス・ポミ (Aphis pomi)、リンゴワタムシ (Eriosoma lanigerum)、モモコフキアブラムシ (Hyalopterus arundinis)、ブドウジラミ (Phylloxera vastatrix)、タマワタムシ (Pemphigus) 種、ムギヒゲナガアブラムシ (Macrosiphum avenae)、ミズス (Myzus) 種、ホップイボアブラムシ (Phorodon humuli)、ムギクビレアブラムシ (Rhopalosiphum padi)、ニドリヒメヨコバイ (Empoasca) 種、エウスケリス・ビロバーツス (Euscelis bilobatus)、ツマグロヨコバイ (Nephotettix cincticeps)、ミズキカタカイガラムシ (Lecanium corni)、オリーブカタカイガラムシ (Saissetia oleae)、ヒメトビウンカ (Laodelphax striatellus)、トビイロウンカ (Nilaparvata lugens)、アカマルカイガラムシ (Aonidiella aurantii)、シロマルカイガラムシ (Aspidiotus hederae)、コナカイガラムシ (Pseudococcus) 種及びキジラミ (Psylla) 種、

鱗翅目 (Lepidoptera) から、例えばワタアカミムシ (Pectinophora gossypiella)、ブパルス・ピニアリウス (Bupalus piniarius)、ケイマトビア・ブルマータ (Cheimatobia brumata)、リソコレチス・ブランカルデラ (Lithocolletis blancardella)、ヒポノメウタ・パデラ (Hyponomeuta padella)、コナガ (Plutella xylostella)、オビカレハ (Malacosoma neustria)、ドクガ種 (Euproctis chrysorrhoea)、マイマイガ (Lymantria) 種、ブクラトリクス・スルベリエラ (Bucculatrix thurberiella)、ミカンハモグリガ (Phyllocnistis

10

20

30

40

50

citrella)、ヤガ (Agrotis) 種、エウクソア (Euxoa) 種、フェルテア (Feltia) 種、ミスジオリング (Earias insulana)、ヒリオシス (Heliothis) 種、ヨトウガ (Mamestra brassicae)、マツキリガ (Panolis flammea)、ヨトウ (Spodoptera) 種、イラクサギンウワバ (Trichoplusia ni)、カルボカプサ・ポモネラ (Carpocapsa pomonella)、シロチョウ (Pieris) 種、ニカメイガ (Chilo) 種、アワノメイガ (Pyrausta nubilalis)、スジコナマダラメイガ (Ephesia kuehniella)、ハチノスツヅリガ (Galleria mellonella)、コイガ (Tineola bisselliella)、イガ (Tinea pellionella)、ホフマンノフィラ・プセウドスプレテルラ (Hofmannophila pseudospretella)、カコエキア・ポダナ (Cacoecia podana)、カプア・レテクラナ (Capua reticulana)、トウヒシントメハマキ (Choristoneura fumiferana)、ブドウホソハマキ (Clysia ambiguella)、チャハマキ (Homona magnanima)、トルトリックス・ビリダーナ (Tortrix viridana)、クナファロケルス (Cnaphalocerus) 種及びイネクビボソハムシ (Oulema oryzae)、

10

甲虫目 (Coleoptera) から、例えばアノビウム・プンクターツム (Anobium punctatum)、コナナガシンクイ (Rhizopertha dominica)、エンドウゾウムシ (Bruchidius obtectus)、インゲンマメゾウムシ (Acanthoscelides obtectus)、ヒロトルベス・バジュルス (Hylotrupes bajulus)、アゲラスチカ・アルニ (Agelastica alni)、コロラドハムシ (Leptinotarsa decemlineata)、カラシナハムシ (Phaedon cochleariae)、ディアブロチカ (Diabrotica) 種、ナトビハムシ (Psylloides chrysocephala)、インゲンテントウ (Epilachna varivestis)、アトマリア (Atomaria) 種、ノコギリヒラタムシ (Oryzaephilus surinamensis)、ハナゾウムシ (Anthonomus) 種、コクゾウムシ (Sitophilus) 種、キンケクチブトリゾウムシ (Otiiorhynchus sulcatus)、バショウオサゾウムシ (Cosmopolites sordidus)、ケウソルリンクス・アッシミリス (Ceuthorrhynchus assimilis)、アルファルファタコゾウムシ (Hypera postica)、カツオブシムシ (Dermites) 種、トゥロゴデルマ (Trogoderma) 種、アンスレヌス (Anthrenus) 種、アッタゲヌス (Attagenus) 種、ヒラタキクイムシ (Lyctus) 種、メリゲセス・アエネウス (Meligethes aeneus)、プテヌス (Ptinus) 種、ニプトゥス・ホロレウクス (Niptus hololeucus)、ニセマルヒョウホンムシ (Gibbium psylloides)、トゥボリウム (Tribolium) 種、チャイロコメノゴミムシダマシ (Tenebrio molitor)、アグリオテス (Agriotes) 種、コノデルス (Conoderus) 種、ヨーロッパコフキコガネ (Melolontha melolontha)、アンフィマロン・ソルステテアリス (Amphimallon solstitialis)、コステリトゥラ・アエアランドカ (Costelytra zealandica) 及びイネミズゾウムシ (Lissorhoptus oryzophilus)、

20

30

40

ハチ目 (Hymenoptera) から、例えば、マツハバチ (Diprion) 種、ナシミバチ (Hoplocampa) 種、ケアリ (Lasius) 種、イエヒメアリ (Monomorium pharaonis) 及びスズメバチ (Vespa) 種、

双翅目 (Diptera) から、例えばヤブカ (Aedes) 種、ハマダラカ (Anopheles) 種、イエカ (Culex) 種、キイロショウジョウバエ (Drosophila melanogaster)、イエバエ (Musca) 種、ヒメイエバエ (Fa

50

nnia) 種、クロバエ (Calliphora erythrocephala)、キンバエ (Lucilia) 種、オビキンバエ (Chrysomyia) 種、ウサギヒフバエ (Cuterebra) 種、ウマバエ (Gastrophilus) 種、シラミバエ (Hypoboscra) 種、サシバエ (Stomoxys) 種、ヒツジバエ (Oestrus) 種、ヒフバエ (Hypoderma) 種、アブ (Tabanus) 種、タンニア (Tannia) 種、ビビオ・ホルツラヌス (Bibio hortulanus)、キモグリバエ (Oscinella frit)、フォルビア (Phorbia) 種、アカザモグリハナバエ (Pegomyia hyoscyami)、チチュウカイミバエ (Ceratitis capitata)、オリブミバエ (Dacus oleae)、チプラ・パルドーサ (Tipula paludosa)、ヒレミア (Hylemyia) 種及びハモグリバエ (Liriomyza) 種、

10

ノミ目 (Siphonaptera) から、例えばケオプスネズミノミ (Xenopsylla cheopsi) 及びニワトリノミ (Ceratophyllus) 種、

クモ綱 (Arachnida) から、例えばイスラエルゴールドスコピーオ (Scorpio maurus)、クロゴケグモ (Latrodectus mactans)、アシブトコナダニ (Acarus siro)、ナガヒメダニ (Argas) 種、カズキダニ (Ornithodoros) 種、ワクモ (Dermanyssus gallinae)、エリオフィネス・リビス (Eriophyes ribis)、フィルロコプトゥルータ・オレイボラ (Phyllocopturta oleivora)、ウシダニ (Boophilus) 種、コイタマダニ (Rhipicephalus) 種、キララマダニ (Amblyomma) 種、イボマダニ (Hyalomma) 種、マダニ (Ixodes) 種、キュウセンヒゼンダニ (Psoroptes) 種、コリオプテス (Chorioptes) 種、ヒゼンダニ (Sarcoptes) 種、ホコリダニ (Tarsonemus) 種、クローバーハダニ (Bryobia praetiosa)、パノニクス (Panonychus) 種、ハダニ (Tetranychus) 種、ヘミタルソネムス (Hemitarsonemus) 種及びヒメハダニ (Brevipalpus) 種、

20

【0239】

植物寄生線虫としては、例えば、ネグサレセンチュウ (Pratylenchus) 種、バナナネモグリセンチュウ (Radopholus similis)、ナミキクセンチュウ (Ditylenchus dipsaci)、ミカンネセンチュウ (Tylenchulus semipenetrans)、シストセンチュウ (Heterodera) 種、グロボデラ (Globodera) 種、ネコブセンチュウ (Meloidogyne) 種、ハガレセンチュウ (Aphelenchoides) 種、ナガハリセンチュウ (Longidorus) 種、オオハリセンチュウ (Xiphinema) 種、ユミハリセンチュウ (Trichodorus) 種及びマツノザイセンチュウ (Bursaphelenchus) 種が挙げられる。

30

【0240】

適切ならば、本発明の化合物は、ある一定の濃度又は施用量で、除草剤又は殺微生物剤として、例えば殺菌剤、抗真菌剤及び殺菌剤として作用させるのにも使用し得る。適切ならば、本発明の活性化合物はまた、別の活性化合物の合成用の中間体及び前駆物質としても使用できる。

40

【0241】

全ての植物及び植物部分は、本発明に従って処理できる。植物とは、本明細書では全ての植物及び植物群、例えば望ましい及び望ましくない野生植物又は作物植物（天然産の作物植物を含む）を意味すると解釈されるべきである。作物植物は、慣用の植物育種法及び最適化法によって、又はバイオテクノロジー法及び組換え法によって、又はこれらの方法の組み合わせによって得ることができる植物、例えばトランスジェニック植物であることができ、また例えば植物育種者の権利によって保護し得るか又は保護し得ない植物品種を含むことができる。植物部分とは、地上及び地下の植物の全ての部分及び器官、例えば新

50

芽、葉、花及び根を意味すると解釈されるべきであり、この例として葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実、種子、根、塊茎及び地下茎を挙げ得る。また、植物部分としては、収穫物及び栄養及び生殖繁殖材料、例えば挿し木、塊茎、地下茎、分枝並びに種子が挙げられる。

【0242】

本発明の活性化合物による植物及び植物部分の本発明の処理は、直接に行うか又は該活性化合物を該植物及び植物部分の周囲、生育環境又は貯蔵空間に慣用の処理法で作用させることによって、例えば浸漬、噴霧、蒸発、燻煙、散布、塗布又は注入することによって及び繁殖材料の場合には、特に種子の場合には一つ又はそれ以上の被覆を施すことによって行われる。

10

【0243】

本発明の活性化合物は、慣用の製剤、例えば液剤、乳濁剤、水和剤、懸濁剤、粉末、粉剤、ペースト剤、水溶剤、粒剤、サスポエマルジョン製剤、活性化合物を含浸させた天然及び合成物質、並びに高分子物質中の微細カプセル剤に変えることができる。

【0244】

これらの製剤は、公知の方法で、例えば活性化合物を増量剤、すなわち液状溶媒及び／又は固形担体と、場合によっては界面活性剤、すなわち乳化剤及び／又は分散剤、及び／又は泡形成剤と混合することにより製造される。

【0245】

使用する増量剤が水である場合には、例えば有機溶媒を補助溶媒として使用することも可能である。液状溶媒として、次の溶媒：芳香族炭化水素、例えばキシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類；塩素化芳香族炭化水素又は塩素化脂肪族炭化水素、例えばクロロベンゼン類、クロロエチレン類又は塩化メチレン；脂肪族炭化水素、例えばシクロヘキササン又はパラフィン類、例えば石油留分、鉱油及び植物油；アルコール類、例えばブタノール又はグリコール及びこれらのエーテル類及びエステル類；ケトン類、例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサノン；強極性溶媒、例えばジメチルホルムアミド及びジメチルスルホキシド；又は水が本質的に適切である。

20

【0246】

適切な固形担体は、例えばアンモニウム塩及び粉碎天然鉱物、例えばカオリン、粘土、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイト又はケイソウ土、並びに粉碎合成鉱物、例えば高分散シリカ、アルミナ及びケイ酸塩類であり；粒剤に適した固形担体は、例えば破碎及び分別天然石、例えば方解石、大理石、軽石、海泡石及びドロマイト、又は無機及び有機粉末の合成顆粒、並びに有機材料例えばおが屑、ヤシ殻、トウモロコシの穂軸及びタバコの茎の顆粒であり；適切な乳化剤及び／又は泡形成剤は、例えば非イオン性乳化剤及び陰イオン性乳化剤、例えばポリオキシエチレン脂肪酸エステル類、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル類、例えばアルキルアリアルポリグリコールエーテル類、アルキルスルホン酸塩類、アルキル硫酸塩類、アリアルスルホン酸塩類又はタンパク質加水分解生成物であり；適切な分散剤は、例えばリグノ亜硫酸塩廃液及びメチルセルロースが適切である。

30

【0247】

粘着付与剤、例えばカルボキシメチルセルロース及び粉末状、粒状又はラテックス状の天然及び合成重合体、例えばアラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニル、又は天然リン脂質、例えばセファリン類及びレシチン類、並びに合成リン脂質が前記の製剤に使用できる。他の可能な添加剤は、鉱油及び植物油である。

40

【0248】

着色剤、例えば無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタン及びプルシアンブルー、並びに有機染料、例えばアリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、並びに微量栄養素、例えば鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデン及び亜鉛の塩を使用することができる。

【0249】

50

前記の製剤は、一般に活性化合物を0.1から95重量%、好ましくは0.5から90重量%含有する。

【0250】

本発明の活性化合物は、このままで使用できるし又はこの製剤で公知の殺菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺虫剤との混合物として使用して活性スペクトルを広げるか又はこのようにして抵抗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、すなわち混合物の活性はこの個々成分の活性よりも優れている。

【0251】

混合物に成分として適切な化合物は、例えば、下記の化合物である：

殺菌剤：

2-フェニルフェノール；8-ヒドロキシキノリンサルフェート；アシベンゾラルーS-メチル；アルジモルフ；アミドフルメト；アムプロピルホス；アムプロピルホス・カリウム；アンドプリム（andoprime）；アニラジン；アザコナゾール；アゾキシストロビン；ベナラキシル；ベノダニル；ベノミル；ベンチアバリカルブ・イソプロピル；ベンザマクリル；ベンザマクリル・イソブチル；ビラナホス；ビナバクリル；ビフェニル；ビテルタノール；ブラストサイジン・S；ブロムコナゾール；ブピリメート；ブチオベート；ブチルアミン；多硫化石灰；カプシマイシン（capsimycin）；カプタホル；キャプタン；カルペンダジム；カルボキシシン；カルプロパミド；カルボン；キノメチオナート；クロベンチアゾン；クロルフエナゾール；クロロネブ；クロロタロニル；クロゾリネート；クロジラコン；シアゾファミド；シフルフェナミド；シモキサニル；シプロコナゾール；シプロジニル；シプロフラム；Dagger G；デバカルブ；ジクロフルアニド；ジクロロン；ジクロロフェン；ジクロシメット；ジクロメジン；ジクロラン；ジエトフェンカルブ；ジフェノコナゾール；ジフルメトリム；ジメチリモール；ジメトモルフ；ジモキシストロビン；ジニコナゾール；ジニコナゾール-M；ジノカップ；ジフェニルアミン；ジピリチオン；ジタリムホス；ジチアノン；ドジン；ドラゾキシロン；エジフェンホス；エポキシコナゾール；エタボキサム；エチリモール；エトリジアゾール；ファモキサドン；フェナミドン；フェナパニル；フェナリモール；フェンブコナゾール；フェンフラム；フェンヘキサミド；フェニトロパン；フェノキサニル；フェンピクロニル；フェンプロピジン；フェンプロピモルフ；ファーバム；フルアジナム；フルベンジミン；フルジオキシニル；フルメトオーバー（flumetover）；フルモルフ（flumorph）；フルオロミド；フルオキサストロビン；フルキンコナゾール；フルルプリミドール；フルシラゾール；フルスルファミド；フルトラニル；フルトリアホル；フォルペット；ホセチル・アルミニウム；ホセチル・ナトリウム；フベリダゾール；フララキシル；フラメトピル；フルカルバニル；フルメシクロックス；グアザチン；ヘキサクロロベンゼン；ヘキサコナゾール；ヒメキサゾール；イマザリル；イミベンコナゾール；イミノクタジン三酢酸塩；イミノクタジン三アルベシル酸塩；ヨードカルブ；イブコナゾール；イブプロベンホス；イブプロジオン；イブプロバリカルブ；イルママイシン；イソプロチオラン；イソバレジオン；カスガマイシン；クレソキシム・メチル；マンコゼブ；マネブ；メフェリムゾン；メパニピリム；メプロニル；メタラキシル；メタラキシル・M；メトコナゾール；メタスルホカルブ；メトフロキサム；メチラム；メトミノストロビン；メトスルホバックス；ミルディオマイシン；マイクロブタニル；マイクロゾリン；ナタマイシン；ニコビフェン（nicobifen）；ニトロタル・イソプロピル；ノビフルムロン；ヌアリモール；オフレース；オリサストロビン；オキサジキシル；オキシリン酸；オキシポコナゾール；オキシカルボキシシン；オキシフェンチン（oxyfenthion）；パクロボトラゾール；ペフラゾエート；ペンコナゾール；ペンシクロン；ホスダイフェン；フサライド；ピコシキストロビン；ピペラリン；ポリオキシシン類；ポリオキシソリム；プロベナゾール；プロクロラズ；プロシミドン；プロパモカルブ；プロパノシン（propanosine）・ナトリウム；プロピコナゾール；プロピネブ；プロキナジド；プロチオコナゾール；ピラクロストロビン；ピラゾホス；ピリフェノックス；ピリメタニル；ピロキロン；ピロキシフル；ピロールニトリン；キンコナゾール；キノキシフェン；キントゼン；シ

10

20

30

40

50

メコナゾール；スピロキサミン；硫黄；テブコナゾール；テクロフタラム；テクナゼン；
 テトシクラシス；テトラコナゾール；チアベンダゾール；チシオフエン；チフルザミド；
 チオファネート・メチル；チラム；チオキシミド；トルクロホス・メチル；トリルフルア
 ニド；トリアジメホン；トリアジメノール；トリアズブチル；トリアゾキシド；トリシク
 ラミド；トリシクラゾール；トリデモルフ；トリフロキシストロビン；トリフルミゾール
 ；トリホリン；トリチコナゾール；ウニコナゾール；バリダマイシンA；ピンクロゾリン
 ；ジネブ；ジラム；ゾキサミド；(2S)-N-[2-[4-[3-(4-クロロフェ
 ニル)-2-プロピニル]オキシ]-3-メトキシフェニル]エチル]-3-メチル-2
 -[(メチルスルホニル)アミノ]ブタンアミド；1-(1-ナフタレニル)-1H-ピ
 ロール-2, 5-ジオン；2, 3, 5, 6-テトラクロロ-4-(メチルスルホニル)ピ
 リジン；2-アミノ-4-メチル-N-フェニル-5-チアゾールカルボキサミド；2-
 クロロ-N-(2, 3-ジヒドロ-1, 1, 3-トリメチル-1H-インデン-4-イル
)-3-ピリジニルカルボキサミド；3, 4, 5-トリクロロ-2, 6-ピリジンジカルボ
 ニトリル；アクチノベート (actinovate)；シス-1-(4-クロロフェニル
)-2-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)シクロヘプタノール；1-(2,
 3-ジヒドロ-2, 2-ジメチル-1H-インデン-1-イル)-1H-イミダゾール
 -5-カルボン酸メチル；炭酸水素カリウム；N-(6-メトキシ-3-ピリジニル)-
 シクロプロパンカルボキサミド；N-ブチル-8-(1, 1-ジメチルエチル)-1-オ
 キサスピロ[4.5]デカン-3-アミン；テトラチオカルボン酸ナトリウム；並びに銅
 塩及び銅製剤、例えばボルドー液；水酸化銅；ナフテン酸銅；オキシ塩化銅；硫酸銅；ク
 フラネブ；亜酸化銅；マンカップパー；オキシシン銅。

10

20

殺細菌剤：

プロモポール、ジクロロフェン、ニトラピリン、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル
 、カスガマイシン、オクチリノン、フランカルボン酸、オキシテトラサイクリン、プロベ
 ナゾール、ストレプトマイシン、テクロフタラム、硫酸銅及び他の銅製剤。

殺虫剤／殺ダニ剤／殺線虫剤：

アバメクチン、ABG-9008、アセフェート、アセキノシル、アセタミプリド、ア
 セトプロール、アクリナトリン、AKD-1022、AKD-3059、AKD-308
 8、アラニカルブ、アルジカルブ、アルドキシカルブ、アレスリン、 α -シペルメトリン
 (アルファメトリン)、アミドフルメト、アミノカルブ、アミトラズ、アバメクチン、A
 Z-60541、アザジラクチン、アザメチホス、アジンホス・メチル、アジンホス・エ
 チル、アゾシクロチン、

30

バチルス・ポピリエ (*Bacillus popilliae*)、バチルス・スフェリ
 カス (*Bacillus sphaericus*)、枯草菌 (*Bacillus sub
 tilis*)、バチルス・スリンジエンシス (*Bacillus thuringien
 sis*)、バチルス・スリンジエンシス株EG-2348、バチルス・スリンジエンシス
 株GC-91、バチルス・スリンジエンシス株NCTC-11821、バキュロウイルス
 、ボーベリア・バシアーナ (*Beauveria bassiana*)、ボーベリア・テ
 ネラ (*Beauveria tenella*)、ベンクロチアズ (benclothiaz)、
 ベンダイオカルブ、ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ベンゾキシメート、 β -シ
 フルトリン、 β -シペルメトリン、ビフェナゼート、ビフェントリン、ビナパクリル、ビ
 オアレスリン、バイオアレスリン-S-シクロペンチル異性体、バイオエタノメトリン、ビ
 オペルメトリン、バイオレスメトリン、ビストリフルロン、BPMC、プロフェンプロックス
 (brofenprox)、プロモホス・エチル、プロモプロピレート、ブロムフェンビ
 ンホス(ーメチル)、BTG-504、BTG-505、ブフェンカルブ、ブプロフェジ
 ン、ブタチオホス、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、ブチルピリダベン、

40

カズサホス、カンフェクロル、カルバリル、カルボフラン、カルボフェノチオン、カル
 ボスルファン、カルタップ、CGA-50439、キノメチオネート、クロルデン、クロ
 ルジメホルム、クロエトカルブ、クロルエトキシホス、クロルフェナピル、クロルフェ
 ンビンホス、クロルフルアズロン、クロルメホス、クロルベンジレート、クロルピクリン、

50

クロルプロキシフェン (chlorproxyfen)、クロルピリホス・メチル、クロルピリホス (・エチル)、クロベパトリン (chlovaporthrin)、クロマフェノジド、シスーシペルメトリン、シスーレスメトリン、シスーペルメトリン、クロシトリン (clocythrin)、クロエトカルブ、クロフェンテジン、クロチアニジン、クロチアゾベン (clothiazoben)、コドレモン、クマホス、シアノフェンホス、シアノホス、シクロブレン (cycloprene)、シクロプロトリン、シドリガ (Cydia pomonella)、シフルトリン、シハロトリン、シヘキサチン、シペルメトリン、シフェノトリン (1R-トランス-異性体)、シロマジン、

DDT、デルタメトリン、ジメトン-S-メチル、ジメトン-S-メチルスルホン、ジアフェンチウロン、ジアリホス、ダイアジノン、ジクロフェンチオン、ジクロルボス、ジコホル、ジクロトホス、ジシクラニル、ジフルベンズロン、ジメフルトリン、ジメトエート、ジメチルビンホス、ジノブトン、ジノカップ、ジノテフラン、ジオフェノラン、ジスルホトン、ドキュセート・ナトリウム、ドフェナピン (dofenapyn)、DOWC O-439、

エフルシラネート (eflusilanate)、エマメクチン、エマメクチン安息香酸塩、エンペントリン (1R-異性体)、エンドスルフアン、接合菌エントモフソーラ (Entomophthora) 種、EPN、エスフェンバレレート、エチオフェンカルブ、エチプロール、エチオン、エトプロホス、エトフェンプロックス、エトキサゾール、エトリムホス、

ファミフル、フェナミホス、フェナザキン、酸化フェンブタズ、フェンフルトリン、フェニトロチオン、フェノブカルブ、フェノチオカルブ、フェノキサクリム、フェノキシカルブ、フェンプロパトリン、フェンピラド、フェンピリトリン、フェンピロキシメート、フェンスルホチオン、フェンチオン、フェントリファニル、フェンバレレート、フィプロニル、フロニカミド、フルアクリプリム、フルアズロン、フルベンジミン、フルプロシトリネート、フルシクロクスロン (flucycloxuron)、フルシトリネート、フルフェネリム、フルフェノクスロン、フルフェンプロックス、フルメトリン、フルピラゾホス、フルテンジン (flutenzine) [フルフェンジン (flufenzine)]、フルバリネート、ホノホス、ホルメタネート、ホルモチオン、ホスメチラン、ホスチアゼート、フブフェンプロックス (fubfenprox) [フルプロキシフェン (fluproxyfen)]、フラチオカルブ、

γ -シハロトリン、 γ -HCH、gossypure、grandlure、顆粒病ウイルス、

ハルフェンプロックス、ハロフェノジド (halofenozide)、HCH、HCN-801、ヘプテノホス、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾックス、ヒドラメチルノン、ハイドロブレン、

IKA-2002、イミダクロプリド、イミプロトリン、インドキサカルブ、ヨードフェンホス、イプロベンホス、イサゾホス、イソフェンホス、イソプロカルブ、イソキサチオン、イベルメクチン、

japonilure、

カデスリン、核多核体病ウイルス、キノブレン、

λ -シハロトリン、リンデン、ルフエヌロン、

マラチオン、メカルバム、メスルフェンホス、メタアルデヒド、メタム・ナトリウム、メタクリホス、メタミドホス、メタリジウム・アニソプリエ (Metharhizium anisopliae)、メタリジウム・フラボビリデ (Metharhizium flavoviride)、メチダチオン、メチオカルブ、メソミル、メトブレン、メトキシクロル、メトキシフェノジド、メトフルトリン、メトルカルブ、メトキサジアゾン、メビンホス、ミルベメクチン、ミルベマイシン、MKI-245、MON-45700、モノクロトホス、モキシデクチン、MTI-800、

ナレッド、NC-104、NC-170、NC-184、NC-194、NC-196、ニクロサミド、ニコチン、ニテンピラム、ニチアジン、NNI-0001、NNI-0

10

20

30

40

50

101、NNI-0250、NNI-9768、ノバルロン、ノビフルムロン、
OK-5101、OK-5201、OK-9601、OK-9602、OK-9701、
OK-9802、オメトエート、オキサミル、オキシジメトン・メチル、

ペシロマイセス・フモソロセウス (Paecilomyces fumosoroseus)、パラチオン・メチル、パラチオン (・エチル)、ペルメトリン (シス、トランス)、マシン油、PH-6045、フェノトリン (1R-トランス異性体)、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホスホカルブ、ホキシム、ピペロニルブトキシド、ピリミカーブ、ピリミホス・メチル、ピリミホス・エチル、オレイン酸カリウム、プラレスリン、プロフェノホス、プロフルトリン、プロメカルブ、プロパホス、プロパルギット、プロペタムホス、プロボキスル、プロチオホス、プロトエート、プロトリフェンブテ (protrifenbutate)、ピメトロジン、ピラクロホス、ピレスメトリン、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリダフェンチオン、ピリダチオン、ピリミジフェン、ピリプロキシフェン、

キナルホス、

レスメトリン、RH-5849、リバピリン、RU-12457、RU-15525、S-421、S-1833、サリチオン、ブチルフォス、SI-0009、シラフルオフェン、スピノサド、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スルフラミド、スルホテップ、スルプロホス、SZI-121、

タウフルバリネート、テブフェノジド、テブフェンピラド、テブピリミホス、テフルベンズロン、テフルトリン、テメホス、テミピンホス、ターバム、テルブホス、テトラクロルピンホス、テトラジホン、テトラメトリン、テトラメトリン (1R-異性体)、テトラサル、θ-シペルメトリン、チアクロプリド、チアメトキサム、チアプロニル、チアトリホス (thiatriphos)、チオシクラムシュウ酸塩、チオジカルブ、チオフアノックス、チオメトン、チオサルタップ・ナトリウム (thiosultap-sodium)、スリンジエンシン (thuringiensin)、トルフェンピラド、トラロシトリン、トラロメトリン、トランスフルトリン、トリアラセン、トリアザメート、トリアゾホス、トリアズロン (triazuron)、トリクロフェニジン、トリクロルホン、トリコデルマ・アトロヴィリデ (Trichoderma atroviride)、トリフルムロン、トリメタカルブ、

バミドチオン、バニリプロール (vaniliprole)、ベルブチン (verbutin)、バーティシリウム・レカニ (Verticillium lecanii)、WL-108477、WL-40027、

YI-5201、YI-5301、YI-5302、

XMC、キシリルカルブ、

ZA-3274、ζ-シペルメトリン、ゾラプロホス (zolaprofos)、ZXI-8901、

化合物 プロピルカルバミン酸3-メチルフェニル (ツマサイドZ)、

化合物 3-(5-クロロ-3-ピリジニル)-8-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-8-アザビシクロ[3. 2. 1]オクタン-3-カルボニトリル (CAS-Reg. No. 185982-80-3) 及び対応する3-エンド-異性体 (CAS-Reg. No. 185984-60-5) (国際公開第WO96/37494号公報、同第WO98/25923号公報参照)、並びに殺虫活性植物抽出物、線虫、真菌又はウイルスを含有する製剤。

【0252】

除草剤などの他の公知の活性化合物との混合物、又は肥料及び生長調節剤、薬害軽減剤及び／又は情報化学物質との混合物も可能である。

【0253】

殺虫剤としてこの市販されている製剤で及びこれらの製剤から調製される使用形態で用いられる場合には、本発明の活性化合物はまた、相乗剤との混合物の形態で存在させることができる。相乗剤は、活性化合物の作用を高める化合物であり、添加される相乗剤がこ

10

20

30

40

50

れ自体活性であることを必要としない。

【0254】

殺虫剤としてこの市販されている製剤で及びこれらの製剤から調製される使用形態で使用される場合には、本発明の活性化合物はまた、植物の生息環境に、植物の部分の表面の又は植物組織に施用した後に活性化合物の分解を抑える抑制剤との混合物として存在させることもできる。

【0255】

市販されている製剤から調製される使用形態の活性化合物の含有量は、幅広い範囲で変化させ得る。前記の使用形態の活性化合物濃度は、活性化合物0.0000001から95重量%まで、好ましくは0.0001から1重量%であり得る。

10

【0256】

本発明の化合物は、使用形態に適切な慣用の方法で施用される。

【0257】

衛生害虫及び貯蔵品の害虫に対して使用する場合には、本発明の活性化合物は、木材及び土壌に対する優れた残留作用によって並びに石灰散布した基体 (s u b s t r a t e) 上のアルカリに対する良好な安定性によって区別される。

【0258】

前記で既に述べたように、本発明に従って全ての植物及びこの部分を処理することが可能である。好ましい形態においては、野生植物種又は慣用の生物学的育種法、例えば異種交配又はプロトプラスト融合法によって得られている植物変種及び植物品種、並びにこれらの変種及び品種の一部が処理される。さらに好ましい実施態様においては、組換え法によって、適切ならば慣用の方法と組み合わせることによって得られるトランスジェニック植物及び植物品種 (遺伝子修飾生物)、並びにこれらの部分が処理される。「部分」又は「植物の部分」又は「植物部分」という用語は、前記で説明してある。

20

【0259】

本発明に従って処理されることが特に好ましい植物は、それぞれ市販されているか又は使用されている植物品種の植物である。植物品種とは、慣用の育種法、突然変異誘発法又は組換えDNA技術によって品種改良されている新規な特性を有する植物を意味すると解釈される。これらは、栽培品種、生物型又は遺伝子型を取り得る。

【0260】

植物種又は植物品種、この生育場所及び生育条件 (土壌、気候、植物期間、養分) に応じて、本発明の処理はまた、超付加 (「相乗」) 効果をもたらし得る。従って、例えば、施用量の低減及び／又は活性スペクトルの拡大及び／又は本発明に従って使用することができる物質及び組成物の活性の増大、よりよい植物生長、高温又は低温に対する耐性の増大、干ばつ又は水もしくは土壌塩分に対する耐性の増大、開花性能の増大、収穫のより容易さ、熟成の促進、より高い収穫量、よりよい品質及び／又はより高い栄養価の収穫品、収穫品のよりよい貯蔵安定性及び／又は加工性が可能であり、これらは実際に期待されるべきであった効果を上回る。

30

【0261】

本発明に従って処理することが好ましいトランスジェニック植物又は植物品種 (すなわち、組換え法によって得られるトランスジェニック植物又は植物品種) としては、遺伝子組換え修飾によりこれらの植物に特に都合のよい有用な特性を付与する遺伝子材料を受け入れた植物全てが挙げられる。このような特性の例は、よりよい植物生長、高温又は低温に対する耐性、干ばつ又は水もしくは土壌塩分に対する耐性の増大、高められた開花性能、収穫のより容易さ、促進された熟成、より高い収穫量、よりよい品質及び／又はより高い栄養価の収穫品、収穫品のよりよい貯蔵安定性及び／又は加工性である。このような特性の別の例、特に挙げなければならない例は、動物害虫及び微生物害虫、例えば昆虫、ダニ、植物病原性の真菌、細菌及び／又はウイルスに対する植物のよりよい防衛能であり、またある種の除草活性化合物に対する植物の高められた抵抗性である。挙げ得るトランスジェニック植物の例は、重要な作物植物、例えば穀類 (コムギ、イネ)、トウモロコシ、

40

50

ダイズ、ジャガイモ、ワタ、タバコ、アブラナ及び果樹植物（リンゴ、ナシ、柑橘系果物及びブドウ）であり、特に重要なものはトウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、ワタ、タバコ及びアブラナである。重視される特性は、特に、植物内で形成される毒素、特にバチルス・スリジエンシス（Bacillus thuringiensis）の遺伝物質によって〔例えば、遺伝子CryIA（a）、CryIA（b）、CryIA（c）、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb及びCryIF及びこれらの組み合わせによって；以下、「Bt植物」という〕植物内で産生される毒素による昆虫、クモ類、線虫及びナメクジ類に対する植物の高められた抵抗性である。また特に重視される別の特性は、全身獲得抵抗性（SAR）、システミン、フィトアレキシン類、エリシター類及び耐性遺伝子並びにこれらに対応して発現されるタンパク質及び毒素による真菌、細菌及びウイルスに対する植物の高められた防衛能である。また特に重視される別の特性は、ある種の除草活性化化合物、例えばイミダゾリノン類、スルホニルウレア類、グリホセート又はホスフィノトリシンに対する植物の高められた耐性である（例えば、「PAT」遺伝子）。当該所望の特性を付与する遺伝子はまた、トランスジェニック植物内に相互に組み合わせて存在させ得る。挙げ得る「Bt植物」の例は、トウモロコシ品種、ワタ品種、ダイズ品種及びジャガイモ品種であり、これらは商品名YIELD GARD（登録商標）（例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ）、Knock Out（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、StarLink（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Bollgard（登録商標）（ワタ）、Nucotn（登録商標）（ワタ）及びNewLeaf（登録商標）（ジャガイモ）として販売されている。挙げ得る除草剤抵抗性植物の例は、トウモロコシ変種、ワタ変種及びダイズ変種であり、これらは商品名Roundup Ready（登録商標）（グリホセート抵抗性、例えばトウモロコシ、ワタ、ダイズ）、Liberty Link（登録商標）（ホスフィノトリシン抵抗性、例えばアブラナ）、IMI（登録商標）（イミダゾリノン抵抗性）及びSTS（登録商標）（スルホニルウレア抵抗性、例えばトウモロコシ）として販売されている。挙げ得る除草剤抵抗性植物（除草剤耐性について慣用の方法で育成させた植物）としては、商品名Clearfield（登録商標）（例えばトウモロコシ）として販売されている変種を挙げ得る。勿論、これらの説明は、これらの遺伝特性又はさらに開発されるべき遺伝特性を有する植物品種（これらの植物は、今後開発され及び／又は市販されるであろう）にも適用される。

【0262】

前記に挙げた植物は、本発明の方法に従って、本発明の前記の一般式Iの化合物又は活性化合物混合物を用いて特に都合のよい方法で処理することができる。また、活性化合物又はこの混合物について前記で述べた好ましい範囲が、これらの植物の処理に適用される。本明細書に具体的に述べた化合物又は混合物を用いて植物を処理することが特に重要である。

【0263】

本発明の活性化合物は、植物害虫、衛生害虫及び貯蔵製品害虫ばかりではなく、動物薬の領域での動物寄生虫（外部寄生虫）、例えばマダニ、軟ダニ、疥癬ダニ、葉ダニ、ハエ（サシバエ及びナメバエ）、寄生性ハエ幼虫、シラミ、ケジラミ、ハジラミ及びノミに対しても作用する。これらの寄生虫としては、下記のものが挙げられる：

シラミ目（Anoplurida）から、例えばブタジラミ（Haematopinus）種、ケモノホソジラミ（Linognathus）種、シラミ（Pediculus）種、フティルス（Phtirus）種及びソレノポテス（Solenopotes）種、

ハジラミ目（Mallophagida）並びにマルツノハジラミ亜目（Amblycerina）及びホソツノハジラミ亜目（Ischrocerina）から、例えばトゥリメノポン（Trimenopon）種、タンカクハジラミ（Menopon）種、トゥリノトン（Trinoton）種、ボビコーラ（Bovicola）種、ウェルネキーラ（Werneckiella）種、レピケントゥロン（Lepikentron）種、ダ

マリナ (Damalina) 種、ケモノジラミ (Trichodectes) 種及びフェリコーラ (Felicola) 種、

双翅目 (Diptera) 並びにネマクトケリナ (Nematocerina) 及びブラキケリナ (Brachycerina) 亜目から、例えばヤブカ (Aedes) 種、ハマダラカ (Anopheles) 種、イエカ (Culex) 種、ブユ (Simulium) 種、エウシムリウム (Eusimulium) 種、フレボトムス (Phlebotomus) 種、ルツォミヤ (Lutzomyia) 種、クリコイデス (Culicoides) 種、メクラアブ (Chrysops) 種、ヒボミトラ (Hybomitra) 種、アティロトゥス (Atylotus) 種、アブ (Tabanus) 種、ゴマフアブ (Haematopota) 種、フィリポミア (Philipomyia) 種、ブラウラ (Br
aula) 種、イエバエ (Musca) 種、ヒドロタエア (Hydrotaea) 種、サシ
バエ (Stomoxys) 種、ハエマトビア (Haematobia) 種、モレルリア (Morellia) 種、ヒメイエバエ (Fannia) 種、ツェツェバエ (Glossi
na) 種、クロバエ (Calliphora) 種、キンバエ (Lucilia) 種、オビ
キンバエ (Chrysomyia)、ヴォールファールトニクバエ (Wohlfahrt
ia) 種、ニクバエ (Sarcophaga) 種、ヒツジバエ (Oestrus) 種、ヒ
フバエ (Hypoderma) 種、ウマバエ (Gasterophilus) 種、シラミ
バエ (Hippobosca) 種、リポプテナ (Lipoptena) 種及びメロファグ
ス (Melophagus) 種、

10

ノミ (Siphonapterida) 目から、例えば、ヒトノミ (Pulex) 種、
イヌノミ (Ctenocephalides) 種、ネズミノミ (Xenopsylla)
種及びニワトリノミ (Ceratophyllus) 種、

20

異翅亜目 (Heteropterida) から、例えばトコジラミ (Cimex) 種、
サシガメ (Triatoma) 種、ロドニウス (Rhodnius) 種及びパンストロン
ギルス (Panstrongylus) 種、

ゴキブリ目 (Blattarida) から、トウヨウゴキブリ (Blatta ori
entalis)、ワモンゴキブリ (Periplaneta americana)、
チャバネゴキブリ (Blattella germanica) 及びチャオビゴキブリ (Supella) 種、

コナダニ (Acarida) 亜綱並びにマダニ亜目 (Metastigmata) 及び
トゲダニ亜目 (Mesostigmata) から、例えばナガヒメダニ (Argas) 種
、カズキダニ (Ornithodoros) 種、オトビウス (Otobius) 種、マダ
ニ (Ixodes) 種、キララマダニ (Amblyomma) 種、オウシマダニ (Boo
philus) 種、カクマダニ (Dermacentor) 種、ハエモフィラリス (Ha
emophysalis) 種、イボマダニ (Hyalomma) 種、コイタマダニ (Rh
ipicephalus) 種、サシダニ (Dermanyssus) 種、ライリーティア
(Raillietia) 種、ニューモニサス (Pneumonyssus) 種、ステル
ノストーマ (Sternostoma) 種及びヘギイダニ (Varroa) 種、

30

ケダニ亜目 (Prostigmata) 及びコナダニ亜目 (Astigmata) から
、例えばアカリダニ (Acarapis) 種、ツメダニ (Cheyletiella)
種、オルニソケイレティア (Ornithocheyletia) 種、ケモチダニ (My
obia) 種、ヒツジツメダニ (Psorergates) 種、ニキビダニ (Demod
ex)、ツツガムシ (Trombicula) 種、リストオロフォルス (Listrop
horus) 種、コナダニ (Acarus) 種、ケナガコナダニ (Tyrophagus)
種、ゴミコナダニ (Caloglyphus) 種、ヒポテクテス (Hypodectes
s) 種、プテロリクス (Pterolichus) 種、キュウセンヒゼンダニ (Psor
optes)、コリオプテス (Chorioptes) 種、ミミヒゼンダニ (Otode
ctes)、ヒゼンダニ (Sarcoptes) 種、ノトエドゥレス (Notoedre
s) 種、クネミドコプテス (Knemidocoptes) 種、シトラデテス (Cyto
dites) 種及びラミノシオプテス (Laminosioptes) 種。

40

50

【0264】

本発明の式（I）の活性化合物はまた、農業生産家畜、例えば牛、羊、山羊、馬、豚、ロバ、ラクダ、水牛、ウサギ、ニワトリ、七面鳥、アヒル、ガチョウ、蜜蜂、この他の愛玩動物、例えば犬、猫、愛玩鳥及び観賞魚、並びにいわゆる実験動物、例えばハムスター、モルモット、ラット及びマウスに寄生する節足動物を駆除するのに適している。これらの節足動物を駆除することによって、死亡例及び生産性の低下（肉、乳、毛、皮革、卵、蜜などについて）が低減されるべきであり、ゆえに本発明の活性化合物を使用することによって、よりいっそう経済的で、容易な畜産が可能である。

【0265】

獣医学分野で、本発明の活性化合物は、公知の方法で、例えば錠剤、カプセル剤、頓服水剤、水薬、顆粒、ペースト剤、ボーラス剤、フィードスルー（feed-through）法及び坐薬の形態での経腸投与によって、例えば注射（筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内など）、移植などの非経口投与によって、鼻内投与によって、例えば浸漬又は入浴、噴霧、滴加及びスポットティング、洗浄及び散布の形態での皮膚使用によって使用され、また活性化合物を含有する成形品、例えば首輪、耳標、尾標、肢帯、端綱、マーキング装置などを用いて使用される。

【0266】

家畜（livestock）、ニワトリ、家畜（domestic animals）などに使用する場合には、式（I）の活性化合物は、該活性化合物を1から80重量%の量で含有する製剤（例えば、粉剤、乳濁液、フロアブル剤）として直接に使用できるし又は100から10000倍希釈後に使用できるし、又は薬浴として使用してもよい。

【0267】

また、本発明の化合物が、工業材料を破壊する昆虫に対して強い殺虫作用を有することが知見された。

【0268】

下記の昆虫を、例として及び好ましい例として挙げ得るが、これらに限定されない：

甲虫目、例えばヒロトルペス・ベジュルス（Hylotrupes bajulus）、クロホルス・ピロシス（Chlorophorus pilosis）、アノビウム・プンクタツム（Anobium punctatum）、ゼストビウム・ルフオビロスム（Xestobium rufovillosum）、プティリヌス・ペクチノコルニス（Ptilinus pecticornis）、デンドロビウム・ペルチネクス（Dendrobium pertinex）、マツザイシバンムシ（Ernobius mollis）、プリオビウム・カルピニ（Priobium carpini）、ヒラタキクイムシ（Lyctus brunneus）、アフリカヒラタキクイムシ（Lyctus africanus）、リクツス・プラニコルリス（Lyctus planicollis）、ナラヒラタキクイムシ（Lyctus linearis）、リクツス・プベスケンス（Lyctus pubescens）、トォロゴキシロン・アエカレ（Trogoxylon aequale）、ケプトヒラタキクイムシ（Minthes rugicollis）、キシレボルス（Xyleborus）種、トリプトデンドロン（Tryptodendron）種、アパテ・モナクス（Apate monachus）、ボストリクス・カプキンス（Bostrychus capucins）、ヘテロボストリクス・ブルンネウス（Heterobostrychus brunneus）、シノキシロン（Sinoxylon）種及びチビタケシンクイ（Dinoderus minutus）、

膜翅目（Dermapterans）、例えばコルリキバチ（Sirex juvenicus）、モミノオオキバチ（Urocerus gigas）、ウロケルス・ギガス・タイグヌス（Urocerus gigas taignus）及びウロケルス・アウグル（Urocerus augur）、

シロアリ類、例えばカロテルメス・フラビコルリス（Kaloterme flavicollis）、アメリカカンザイシロアリ（Cryptotermes brevis）

10

20

30

40

50

s)、ヘテロテルメス・インディコーラ (Heterotermes indicola)、キアシシロアリ (Reticulitermes flavipes)、レティクリテルメス・サントネンシス (Reticulitermes santonensis)、レティクリテルメス・ルシフグス (Reticulitermes lucifugus)、ムカシシロアリ (Mastotermes darwiniensis)、ネバタオオシロアリ (Zootermopsis nevadensis) 及びイエシロアリ (Coptotermes formosanus)、

シミ目、例えばセイヨウシミ (Lepisma saccharina)。

【0269】

本明細書において工業材料とは、非生物材料、例えば好ましくはプラスチック類、接着剤、糊、紙及び厚紙、皮革、木材及び木工製品並びに塗料を意味すると解釈されるべきである。

10

【0270】

昆虫による攻撃から保護するべきことが極めて特に好ましい材料は、木材及び木工製品である。

【0271】

本発明の組成物又はこのような組成物を含有する混合物で保護することができる木材及び木工製品は、例えば、建造用木材、木製梁、鉄道枕木、橋脚部品、栈橋、木製車両、箱、パレット、コンテナ、電柱、木製パネル、木製窓及びドア、プライウッド、合板、建具又は一般的に家屋建造物もしくは建造物用建具に使用される木製品を意味すると解釈されるべきである。

20

【0272】

本発明の活性化化合物は、このままで使用できるし、濃厚物の形態で使用できるし又は一般的に慣用の製剤、例えば粉末、顆粒、溶液、懸濁液、乳濁液又はペーストで使用できる。

【0273】

前記の製剤は、これ自体公知の方法で製造することができ、例えば活性化化合物を少なくとも1種の溶媒又は希釈剤、乳化剤、分散剤及び／又は結合剤又は固定化剤、撥水剤、所望ならば乾燥剤及びUV安定剤並びに適切ならば着色剤及び顔料、並びに他の加工補助剤と混合することによって製造することができる。

30

【0274】

木材及び加工木材の保護に使用される殺虫剤組成物又は濃厚物は、本発明の活性化化合物を0.0001から95重量%、特に0.001から60重量%の濃度で含有する。

【0275】

使用する組成物又は濃厚物の量は、昆虫の種類や発生及び媒体に依存する。最適施用量は、それぞれ一連の試験で使用について決定できる。しかし、一般的には、保護すべき材料を基準として活性化化合物を0.0001から20重量%、好ましくは0.001から10重量%使用するのが十分である。

【0276】

使用される適切な溶媒及び／又は希釈剤は、有機化学溶媒もしくは溶媒混合物及び／又は低揮発性の油性もしくは油様有機化学溶媒もしくは溶媒混合物及び／又は極性有機化学溶媒もしくは溶媒混合物及び／又は水、並びに適切ならば乳化剤及び／又は湿潤剤である。

40

【0277】

使用することが好ましい有機化学溶媒は、35よりも大きい蒸発数と30℃よりも高い引火点、好ましくは45℃よりも高い引火点をもつ油性又は油様溶媒である。使用されるこのような低い揮発性を有し及び水に溶解しない油性又は油様溶媒として使用される物質は、適切な鉱油又はこの芳香族留分であるか、又は鉱油含有溶媒混合物、好ましくはホワイトスピリット、石油及び／又はアルキルベンゼンである。

【0278】

50

都合よく使用される物質は、170から220℃の沸点範囲をもつ鉱油、170から220℃の沸点範囲をもつホワイトスピリット、250から350℃の沸点範囲をもつスピンドル油、160から280℃の沸点範囲をもつ石油及び芳香族炭化水素、テルペンチン油などである。

【0279】

好ましい実施態様では、180から210℃の沸点範囲をもつ液状脂肪族炭化水素又は180から220℃の沸点範囲をもつ芳香族炭化水素と脂肪族炭化水素との高沸点混合物及び／又はスピンドル油及び／又はモノクロナフタレン、好ましくは α -モノクロナフタレンが使用される。

【0280】

35よりも大きい蒸発数と30℃よりも高い引火点、好ましくは45℃よりも高い引火点をもつ低揮発性の有機油性又は油様溶媒は、溶媒混合物が同様に35よりも大きい蒸発数と30℃よりも高い引火点、好ましくは45℃よりも高い引火点をもつこと及び殺虫剤及び／又は殺菌剤混合物がこの溶媒混合物に溶解又は乳化できることを条件として、この一部を高揮発性又は中揮発性の有機化学溶媒で置換することができる。

【0281】

好ましい実施態様においては、有機化学溶媒又は溶媒混合物、又は脂肪族極性有機化学溶媒又は溶媒混合物の一部が置換される。使用されることが好ましい物質は、ヒドロキシル基及び／又はエステル基及び／又はエーテル基を有する脂肪族有機化学溶媒、例えばグリコールエーテル、エステルなどである。

【0282】

本発明の範囲内で使用される有機化学結合剤は、これ自体公知であり及び水び希釈でき及び／又は使用する有機化学溶媒に溶解又は分散又は乳化することができる合成樹脂及び／又は結合性乾性油であり、特にアクリル酸樹脂、ビニル樹脂、例えばポリ酢酸ビニル、ポリエステル樹脂、重縮合又は重付加樹脂、ポリウレタン樹脂、アルキド樹脂又は変性アルキド樹脂、フェノール樹脂、炭化水素樹脂、例えばインデン／クマロン樹脂、シリコン樹脂、乾性植物油及び／又は乾性油及び／又は天然樹脂及び／又は合成樹脂を基材とした物理的乾燥性結合剤からなるか又はこれらを含含有してなる結合剤である。

【0283】

結合剤として使用される合成樹脂は、エマルジョン、分散物又は溶液の形態で使用できる。また、最大で10重量%のビチューメン又はビチューメン様物質も、結合剤として使用することができる。さらにまた、これ自体公知の着色剤、顔料、撥水剤、臭気中和物質及び阻害剤又は防錆剤なども使用できる。

【0284】

本発明によれば、前記の組成物又は濃厚物は、有機化学結合剤として、少なくとも1種のアルキド樹脂又は変性アルキド樹脂及び／又は乾性植物油を含有することが好ましい。45重量%を超える含油量、好ましくは50から68重量%の含油量を有するアルキド樹脂が、本発明に従って使用されることが好ましい。

【0285】

前記の結合剤の全部又は一部は、固定化剤（混合物）又は可塑剤（混合物）で置換することができる。これらの添加剤は、活性化合物の蒸発、結晶化又は沈降を防止することを目的とする。これらの添加剤は、結合剤の0.01から30%（使用する結合剤100%を基準として）を置換することが好ましい。

【0286】

可塑剤は、フタル酸エステル、例えばフタル酸ジブチル、フタル酸ジオクチル又はフタル酸ベンジルブチル；リン酸エステル、例えばリン酸トリブチル；アジピン酸エステル、例えばアジピン酸ジ（2-エチルヘキシル）；ステアリン酸エステル、例えばステアリン酸ブチル又はステアリン酸アミル；オレイン酸エステル、例えばオレイン酸ブチル；グリセリンエーテル又は比較的高分子量のグリコールエーテル、グリセリンエステル及びp-トルエンスルホン酸エステルの化学分類のものである。

【0287】

固定化剤は、ポリビニルアルキルエーテル、例えばポリビニルメチルエーテル、又はケトン類、例えばベンゾフェノン又はエチレンベンゾフェノンを化学的に基剤とする。

【0288】

溶媒又は希釈剤として特に適したものは、適切ならば前記の有機化学溶媒又は希釈剤、乳化剤及び分散剤の1種又はそれ以上との混合物としての水である。

【0289】

木材の特に効果的な保護は、大規模な工業的含浸法によって、例えば減圧法、二重減圧法又は加圧法によって達成される。

【0290】

適切ならば、すぐ使用できる組成物は、他の殺虫剤をさらに含有することができ、また適切ならば1種又はそれ以上の殺菌剤をさらに含有することができる。

【0291】

混合し得る適切な追加成分は、国際特許出願公開第WO 94/29268号公報に記載の殺虫剤及び殺菌剤であることが好ましい。この公報に記載の化合物は、本出願の構成要素であることは明白である。

【0292】

混合し得る極めて特に好ましい成分は、殺虫剤、例えばクロルピリホス、ホキシム、シラフルオフィン、アルファメトリン、シフルトリン、シベルメトリン、デルタメトリン、ペルメトリン、イミダクロプリド、NI-25、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、トランスフルトリン、チアクロプリド、メトキシフェノキシド及びトリフルムロン、クロチアニジン、スピノサド、テフルトリンであり、および殺菌剤、例えばエポキシコナゾール、ヘキサコナゾール、アザコナゾール、プロピコナゾール、テブコナゾール、シプロコナゾール、メトコナゾール、イマザリル、ジクロフルアニド、トリルフルアニド、3-ヨード-2-プロピニルブチルカルバメート、N-オクチル-イソチアゾリン-3-オン及び4,5-ジクロロ-N-オクチルイソチアゾリン-3-オンである。

【0293】

本発明の化合物は、同時に、塩水又は汽水と接触する物体、特に船体、スクリーン、網、建造物、係留及び信号設備を付着物から保護するのに使用される。

【0294】

付着性の貧毛綱 (Oligochaeta)、例えばサンザシゴカイ科 (Serpulidae) による付着物及びレダモルファ (Ledamorphia) 群 (フジツボ類) の貝及び種、例えば種々のエボシガイ (Lepas) 種及びスカルペルム (Scalpellum) 種による付着物又はフジツボ下目 (Balanomorpha) 群 (フジツボ) の種、例えばフジツボ (Balanus) 種又はポリキペス (Pollicipes) 種による付着物は、船舶の摩擦抵抗を大きくし、この結果、より大きなエネルギー消費及びさらには頻繁な乾ドックにおける居留による運転コストの著しい増加を招く。

【0295】

藻類、例えばシオミドロ (Ectocarpus) 種及びケラミウム (Ceramium) 種による付着物の他に、蔓脚類 (Cirripedia) (cirriped crustaceans) という一般名に入る付着性エントモストラカ (Entomosthera) 群による付着物が特に重要である。

【0296】

意外にも、今般、本発明の化合物が単独で又は他の活性化合物との組み合わせで顕著な防汚作用をもつことが知見された。

【0297】

本発明の化合物を単独で又は他の活性化合物と組み合わせて使用すると、重金属例えば、ビス(トリアルキル錫)スルフィド、トリ-*n*-ブチル錫ラウレート、トリ-*n*-ブチル錫クロリド、酸化銅(I)、トリエチル錫クロリド、トリ-*n*-ブチル(2-フェニル-4-クロロフェノキシ)錫、トリブチル錫オキシド、モリブデンジスルフィド、酸化ア

10

20

30

40

50

ンチモン、高分子チタン酸ブチル、フェニル（ビスピリジン）ビスマスクロリド、トリ－
n－ブチル錫フルオリド、エチレンビスチオカルバミン酸マンガン、ジメチルジチオカル
バミン酸亜鉛、エチレンビスチオカルバミン酸亜鉛、2－ピリジンチオール－1－オキシ
ドの亜鉛塩及び銅塩、ビスジメチルジチオカルバモイルエチレンビスチオカルバミン酸亜
鉛、酸化亜鉛、エチレン－ビスジチオカルバミン酸銅（I）、チオシアン酸銅、ナフテン
酸銅及びトリブチル錫ハライドの使用を不要にするか又はこれらの化合物の濃度を実質的
に下げることが可能にする。

【0298】

適切ならば、すぐ使用できる防汚塗料は、追加成分として他の活性化合物、好ましくは
殺藻剤、殺菌剤、除草剤、殺軟体動物剤、又は他の防汚活性化合物を含有することができ
る。

10

【0299】

本発明の防汚組成物との組み合わせに適した好ましい成分は、下記のものである：

殺藻剤、例えば2－tert－ブチルアミノ－4－シクロプロピルアミノ－6－メチル
チオール、3，5－トリアジン、ジクロロフェン、ジウロン、エンドタール、フェンチン
アセテート、イソプロツロン、メタベンズチアズロン、オキシフルオルフェン、キノクラ
ミン及びテルブトリン；

殺菌剤、例えばベンゾ[b]チオフェンカルボン酸シクロヘキシルアミド－S，S－ジ
オキシド、ジクロフルアニド、フルオロフォルベット、3－ヨード－2－プロピニルブチ
ルカルバメート、トリルフルアニド並びにアゾール類、例えばアザコナゾール、シプロコ
ナゾール、エポキシコナゾール、ヘキサコナゾール、メトコナゾール、プロピコナゾール
及びテブコナゾール；

20

殺軟体動物剤、例えばフェンチンアセテート、メタアルデヒド、メチオカルブ、ニクロ
サミド、チオジカルブ及びトリメタカルブ、鉄キレート；

又は慣用の防汚活性化合物、例えば4，5－ジクロロ－2－オクチル－4－イソチアゾ
リン－3－オン、ジヨードメチルパラトリルスルホン、2－（N，N－ジメチルチオカル
バモイルチオ）－5－ニトロチアジル、2－ピリジンチオール－1－オキシドのカリウム
塩、銅塩、ナトリウム塩及び亜鉛塩、ピリジントリフェニルボラン、テトラブチルジスタ
ノキサン、2，3，5，6－テトラクロロ－4－（メチルスルホニル）ピリジン、2，4
，5，6－テトラクロロイソフタロニトリル、テトラメチルチウラムジスルフィド及び2
，4，6－トリクロロフェニルマレイミド。

30

【0300】

使用する防汚組成物は、本発明の化合物の発明の活性化合物を0.001から50重量
%、特に0.01から20重量%の濃度で含有する。

【0301】

また、本発明の防汚組成物は、慣用の成分、例えば、Ungerer, Chem. I
nd., 1985, 37, 730-732 及び Williams, Antifoul
ing Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 197
3に記載の成分を含有する。

【0302】

40

本発明の殺藻、殺菌、殺軟体動物活性化合物及び殺虫活性化合物の他に、防汚塗料は特
に結合剤を含有する。

【0303】

認められている結合剤の例は、溶媒系中のポリ塩化ビニル、溶媒系中の塩素化ゴム、溶
媒系特に水性系中のアクリル樹脂、水性分散物又は有機溶媒系の形態の塩化ビニル／酢酸
ビニル共重合体系、ブタジエン／スチレン／アクリロニトリルゴム、乾性油 例えば亜麻
仁油、タール又はビチューメン、アスファルト及びエポキシ化合物と組み合わせた樹脂エ
ステル又は変性硬化樹脂、少量の塩素ゴム、塩素化ポリプロピレン及びビニル樹脂である
。

【0304】

50

適切ならば、塗料はまた、海水に溶けないことが好ましい無機顔料、有機顔料又は着色剤を含有する。塗料はまた、活性化合物の制御された放出を可能にするためにロジンなどの物質を含有していてもよい。さらにまた、塗料は、可塑剤、流動学的性質に影響を及ぼす変性剤及び他の慣用の成分を含有していてもよい。本発明の化合物又は前記の混合物はまた、自己研磨性防汚系に配合されてもよい。

【0305】

また本発明の活性化合物は、例えば住居、工場ホール、事務所、車両操縦室などの密閉空間に認められる動物害虫、特に昆虫類、クモ形類動物及びダニ類を防除するのに適している。本発明の活性化合物は、これらの害虫を防除するための家庭用殺虫剤製品に単独で又は他の活性化合物及び補助剤と組み合わせて使用できる。発明の活性化合物は、感受性及び抵抗性の種や全ての発育段階に対して活性である。これらの害虫としては、下記の害虫が挙げられる：

カサゴ目 (Scorpionidea) から、例えば、サハライエロースコーピオン (Buthus occitanus)、

ダニ目 (Acarina) から、例えば、ペルシャダニ (Argas persicus)、鳩扁ダニ (Argas reflexus)、ハダニ (Bryobia) 種、ワクモ (Dermanyssus gallinae)、グリキファグス・ドメスチクス (Glyciphagus domesticus)、オルニトドルス・モウバートゥ (Ornithodoros moubat)、クリイロコイタマダニ (Rhipicephalus sanguineus)、トゥロンビクラ・アルフレッドゥゲシ (Trombicula alfreddugesi)、ネウトゥロビクラ・アウトゥムナリス (Neutrombicula autumnalis)、デルマトファゴイデス・プテロニシムス (Dermatophagoides pteronissimus) 及びデルマトファゴイデス・フォリネ (Dermatophagoides forinae)、

クモ目 (Araneae) から、例えば、オオツチグモ科 (Aviculariidae) 及びコガネクモ科 (Araneidae)、

メクラグモ目 (Opiliones) から、例えば、プセウドコルピオーネス・ケリフェル (Pseudoscorpiones chelifer)、プセウドコルピオーネス・ケリディウム (Pseudoscorpiones cheiridium) 及びオピリオーン・ファランギウム (Opiliones phalangium)、

等脚目 (Isopoda) から、例えば、オニクス・アセルス (Oniscus asellus) 及びワラジウムシ (Porcellio scaber)、

ヤスデ類 (Diplopoda) から、例えば、ブラニウルス・グッツラートゥス (Blaniulus guttulatus) 及びポリデスムス (Polydesmus) 種、

唇脚綱 (Chilopoda) から、例えばツチムカデ (Geophilus) 種、

シミ亜目 (Zygentoma) から、例えば、クテノレピスマ (Ctenolepisma) 種、セイヨウシミ (Lepisma saccharina) 及びレピスマデス・インクィリヌス (Lepismodes inquilinus)、

ゴキブリ目 (Blattaria) から、例えば、トウヨウゴキブリ (Blatta orientalis)、チャバネゴキブリ (Blattella germanica)、オキナワチャバネゴキブリ (Blattella asahinai)、ロイコファエア・マデラエ (Leucophaea maderae)、パンクローラ (Panchlora) 種、ウッドゴキブリ (Parcoblatta) 種、コワモンゴキブリ (Periplaneta australasiae)、ワモンゴキブリ (Periplaneta americana)、トビイロゴキブリ (Periplaneta brunnea)、クロゴキブリ (Periplaneta fuliginosa) 及びチャオビゴキブリ (Supella longipalpa) 種、

長弁亜目 (Saltatoria) から、例えば、ヨーロッパイエコオロギ (Achetia domesticus)、

10

20

30

40

50

ハサミムシ目 (Dermaptera) から、例えば、ヨーロッパクギヌキハサミムシ (Forficula auricularia)、

シロアリ目 (Isoptera) から、例えば、カロテルメス (Kaloterмес) 種及びヤマトシロアリ (Reticulitermes) 種、

チャタテムシ目 (Psocoptera) から、例えば、レピナツス (Lepinat us) 種及びリポスケリス (Liposcelis) 種、

コレプテラ (Coleptera) から、例えば、アンスレヌス (Anthrenu s) 種、アッタゲヌス (Attagenus) 種、カツヲブシムシ (Dermestes) 種、コゴメゴミムシダマシ (Latheticus oryzae)、ネクロビア (Necrobia) 種、プテヌス (Ptinus) 種、コナナガシンクイ (Rhizope rtha dominica)、グラナリアコクゾウムシ (Sitophilus gr anaries)、コクゾウムシ (Sitophilus oryzae)、コクゾウ ムシ (Sitophilus zeamais) 及びジンサンシバンムシ (Stegob ium paniceum)、

双翅目 (Diptera) から、例えば、ネッタイシマカ (Aedes aegypt i)、ヒトスジシマカ (Aedes albopictus)、アエデス・タエニオリン クス (Aedes taeniorhynchus)、ハマダラカ (Anopheles) 種、クロバエ (Calliphora erythrocephala)、クリソゾー ナ・プルビアルス (Chrysosona pluvialis)、ネッタイイエカ (C ulex quinquefasciatus)、アカイエカ (Culex pipie ns)、クレックス・タルサリス (Culex tarsalis)、ショウジョウバエ (Drosophila) 種、ヒメイエバエ (Fannia canicularis)、イエバエ (Musca domestica)、サシチョウバエ (Phlebotom us) 種、サルコファーガ・カルナルア (Sarcophaga carnaria)、 ブユ (Simulium) 種、サシバエ (Stomoxys calcitrans) 及 びチブラ・パルドーサ (Tipula paludosa)、

鱗翅目 (Lepidoptera) から、例えば、アクロイア・グリセルラ (Achr oia grisella)、ハチノスツヅリガ (Galleria mellonel la)、ノシメマダラメイガ (Plodia interpunctella)、チネア ・コアケルラ (Tinea cloacella)、イガ (Tinea pellion ella) 及びコイガ (Tineola bisselliella)、

ノミ目 (Siphonaptera) から、例えば、イヌノミ (Ctenocephal ides canis)、ネコノミ (Ctenocephalides felis)、 ヒトノミ (Pulex irritans)、スナノミ (Tunga penetran s) 及びケオプスネズミノミ (Xenopsylla cheopis)、

膜翅目 (Hymenoptera) から、例えば、カンポノトゥス・ヘルクレアヌス (Camponotus herculeanus)、クロクサアリ (Lasius fu liginosus)、トビイロケアリ (Lasius niger)、アメイロケアリ (Lasius umbratus)、イエヒメアリ (Monomorium phar aonis)、スズメバチ (Paravespula) 種及びトビイロシワアリ (Tet ramorium caespitum)、

シラミ目 (Anoplura) から、例えば、アタマジラミ (Pediculus h umanus capitis)、コロモジラミ (Pediculus humanus corporis) 及びケジラミ (Phthirus pubis)、

半翅目 (Heteroptera) から、例えば、ネッタインアンキンムシ (Cimex hemipterus)、トコジラミ (Cimex lectularius)、ロー デヌス・プロリクス (Rhodinus prolixus) 及びブラジルサシガメ (T riatoma infestans)。

【0306】

本発明の活性化合物は、家庭用殺虫剤の分野で、単独で又は他の適切な活性化合物、例

10

20

30

40

50

例えばリン酸エステル、カルバメート、ピレスロイド、ネオニコチノイド、生長調節剤又は公知のクラスの殺虫剤からの活性化合物と組み合わせて使用できる。

【0307】

本発明の活性化合物は、エアゾール、非加圧スプレー製品、例えばポンプ付き及びアトマイザー付きスプレー、自動煙霧装置、噴霧器、フォーム、ゲル、セルロース又は重合体製の蒸発剤を有する蒸発器製品、液体蒸発器、ゲル及び膜式蒸発器、噴射剤駆動蒸発器、エネルギーフリーか又は受動蒸発装置、防虫紙、防虫バッグ及び防虫ゲルとして使用され、展着用餌又は誘引ステーションにおける顆粒又は粉末として使用される。

【0308】

本発明の活性化合物は、落葉剤、乾燥剤、茎枯剤及び特に除草剤として使用することができる。雑草とは、最も広い意味では、望まれない場所で生育する全ての植物を意味すると解釈される。本発明の物質が非選択性除草剤又は選択性除草剤として作用するかどうかは、本質的に施用量に依存する。

【0309】

本発明の活性化合物は、例えば、下記の植物に使用することができる：

次の属の双子葉雑草：イチビ属 (Abutilon)、ヒユ属 (Amaranthus)、ブタクサ属 (Ambrosia)、アノダ属 (Anoda)、カミツレ属 (Anthemis)、イワムシロ属 (Aphanes)、ハマアカザ属 (Atriplex)、ヒナギク属 (Bellis)、センダングサ属 (Bidens)、ナズナ属 (Capsella)、ヒレアザミ属 (Carduus)、カワラケツメイ属 (Cassia)、ヤグルマギク属 (Centaurea)、アカザ属 (Chenopodium)、アザミ属 (Cirsium)、セイヨウヒルガオ属 (Convolvulus)、チョウセンアサガオ属 (Datura)、ヌスビトハギ属 (Desmodium)、エメクス属 (Emex)、エゾスズシロ属 (Erysimum)、トウダイグサ属 (Euphorbia)、チシマオドリコソウ属 (Galeopsis)、コゴメギク属 (Galinsoga)、ヤエムグラ属 (Galium)、フヨウ属 (Hibiscus)、イボメア属 (Ipomoea)、ホウキギ属 (Kochia)、オドリコソウ属 (Lamium)、マメグンバイナズナ属 (Lepidium)、アゼトウガラシ属 (Lindernia)、シカギク属 (Matricaria)、ハッカ属 (Mentha)、ヤマアイ属 (Mercurialis)、ザクロソウ属 (Mullugo)、ワスレナグサ属 (Myosotis)、ケシ属 (Papaver)、アサガオ属 (Pharbitis)、オオバコ属 (Plantago)、タデ属 (Polygonum)、スベリヒユ属 (Portulaca)、キンポウゲ属 (Ranunculus)、ダイコン属 (Raphanus)、イヌガラシ属 (Rorippa)、キカシグサ属 (Rotala)、ギシギシ属 (Rumex)、オカヒジキ属 (Salsola)、セネキオ属 (Senecio)、セスバニア属 (Sesbania)、シダ属 (Sida)、シロガラシ属 (Sinapis)、ナス属 (Solanum)、ノゲシ属 (Sonchus)、ナガボノウルシ属 (Sphenoclea)、ハコベ属 (Stellaria)、タンポポ属 (Taraxacum)、グンバイナズナ属 (Thlaspi)、シロツメクサ属 (Trifolium)、イラクサ属 (Urtica)、クワガタソウ属 (Veronica)、スミレ属 (Viola)、オナモミ属 (Xanthium)。

【0310】

次の属の双子葉作物：ラッカセイ属 (Arachis)、フダンソウ属 (Beta)、アブラナ属 (Brassica)、キュウリ属 (Cucumis)、カボチャ属 (Cucurbita)、ヒマワリ属 (Helianthus)、ニンジン属 (Daucus)、ダイズ属 (Glycine)、ワタ属 (Gossypium)、サツマイモ属 (Ipomoea)、アキノノゲシ属 (Lactuca)、アマ属 (Linum)、トマト属 (Lycopersicon)、タバコ属 (Nicotiana)、インゲンマメ属 (Phaseolus)、エンドウ属 (Pisum)、ナス属 (Solanum)、ソラマメ属 (Vicia)。

10

20

30

40

50

【0311】

次の属の単子葉雑草：エギロプス属 (Aegilops)、カモジグサ属 (Agropyron)、ヌカボ属 (Agrostis)、スズメノテッポウ属 (Alopecurus)、セイヨウヌカボ属 (Apera)、カラスムギ属 (Avena)、ビロードキビ属 (Brachiaria)、スズメノチャヒキ属 (Bromus)、クリノイガ属 (Cenchrus)、ツユクサ属 (Commelina)、ギョウシバ属 (Cynodon)、カヤツリグサ属 (Cyperus)、タツノメガヤ属 (Dactyloctenium)、メヒシバ属 (Digitaria)、イヌビエ属 (Echinochloa)、ハリイ属 (Eleocharis)、オヒシバ属 (Eleusine)、スズメガヤ属 (Eragrostis)、ネルコビエ属 (Eriochloa)、ウシノケグサ属 (Festuca)、テンツキ属 (Fimbristylis)、ヘテランテラ属 (Heteranthera)、チガヤ (Imperata)、カモノハシ属 (Ischaemum)、アゼガヤ属 (Leptochloa)、ドクムギ属 (Lolium)、ミズアオイ属 (Monochoria)、キビ属 (Panicum)、スズメノヒエ属 (Paspalum)、クサヨシ属 (Phalaris)、アワガエリ属 (Phleum)、スズメノカタビラ属 (Poa)、ロットボエリア属 (Rottboellia)、オモダカ属 (Sagittaria)、ホタルイ属 (Scirpus)、エノコログサ属 (Setaria)、モロコシ属 (Sorghum)。

10

【0312】

次の属の単子葉作物：ネギ属 (Allium)、パイナップル属 (Ananas)、クサスギカズラ属 (Asparagus)、カラスムギ属 (Avena)、オオムギ属 (Hordeum)、イネ属 (Oryza)、キビ属 (Panicum)、サトウキビ属 (Saccharum)、ライムギ属 (Secale)、モロコシ属 (Sorghum)、ライコムギ属 (Triticale)、コムギ属 (Triticum)、トウモロコシ属 (Zea)。

20

【0313】

しかしながら、本発明の活性化合物の使用は、これらの属に決して限定されず、同じ方法で他の植物にも拡大される。

【0314】

本発明の化合物は、濃度に依存して、例えば工業地域及び線路、並びに樹木があるか又は無い道路及び空き地の雑草の非選択的防除に適している。同様に、本発明の化合物は、多年生作物、例えば森林、観賞用植木、果樹園、ブドウ園、柑橘類果樹園、クルミ園、バナナ園、コーヒ園、茶園、ゴム園、油ヤシ園、カカオ園、軟果樹園及びホップ畑、芝生、芝地及び牧草地の雑草の防除に使用できるし、また1年生作物の雑草の選択的防除に使用できる。

30

【0315】

本発明の前記の式 (I) の化合物は、土壌及び植物地上部分に使用した場合には強い除草活性と幅広い活性スペクトルを有する。ある程度までは、前記化合物は、発芽前処理及び発芽後、単子葉作物及び双子葉作物において単子葉雑草及び双子葉雑草の選択的防除にも適している。

40

【0316】

本発明の化合物は、ある一定の濃度又は施用量で、動物害虫及び真菌性又は細菌性の植物病害の防除にも使用できる。適切ならば、本発明の活性化合物はまた、別の活性化合物の合成用の中間体及び前駆物質としても使用できる。

【0317】

本発明の活性化合物は、慣用の製剤、例えば液剤、乳濁剤、水和剤、懸濁剤、粉末、粉剤、ペースト剤、水溶剤、粒剤、サスポエマルジョン製剤、活性化合物を含浸させた天然及び合成物質、並びに高分子物質中の微細カプセル剤に変えることができる。

【0318】

これらの製剤は、公知の方法で、例えば活性化合物を増量剤、すなわち液状溶媒及び／

50

又は固形担体と、場合によっては界面活性剤、すなわち乳化剤及び／又は分散剤、及び／又は泡形成剤を用いて混合することにより製造される。

【0319】

使用する増量剤が水である場合には、例えば有機溶媒を補助溶媒として使用することも可能である。適切な液状溶媒は、本質的には芳香族炭化水素、例えばキシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類；塩素化芳香族炭化水素又は塩素化脂肪族炭化水素、例えばクロロベンゼン類、クロロエチレン類又は塩化メチレン；脂肪族炭化水素、例えばシクロヘキサン又はパラフィン類、例えば石油留分；鉱油及び植物油；アルコール類、例えばブタノール又はグリコール及びこれらのエーテル類及びエステル類；ケトン類、例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサノン；強極性溶媒、例えばジメチルホルムアミド及びジメチルスルホキシド；又は水である。

10

【0320】

適切な固形担体は、例えばアンモニウム塩及び粉碎天然鉱物、例えばカオリン、粘土、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイト又はケイソウ土、並びに粉碎合成鉱物、例えば微細シリカ、アルミナ及びケイ酸塩類であり；粒剤に適した固形担体は、例えば破碎及び分別天然石、例えば方解石、大理石、軽石、海泡石及びドロマイト、又は無機及び有機粉末の合成顆粒、並びに有機材料例えばおが屑、ヤシ殻、トウモロコシの穂軸及びタバコの茎の顆粒であり；適切な乳化剤及び／又は泡形成剤は、例えば非イオン性乳化剤及び陰イオン性乳化剤、例えばポリオキシエチレン脂肪酸エステル類、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル類、例えばアルキルアリアルポリグリコールエーテル類、アルキルスルホン酸塩類、アルキル硫酸塩類、アリアルスルホン酸塩類及び又はタンパク質加水分解生成物であり；適切な分散剤は、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。

20

【0321】

粘着付与剤、例えばカルボキシメチルセルロース並びに粉末状、粒状又はラテックス状の天然及び合成重合体、例えばアラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニル、並びに天然リン脂質、例えばセファリン類及びレシチン類、並びに合成リン脂質が、前記の製剤に使用できる。他の可能な添加剤は、鉱油及び植物油である。

【0322】

着色剤、例えば無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタン及びプルシアンブルー、並びに有機染料、例えばアリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、並びに微量栄養素、例えば鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデン及び亜鉛の塩を使用することができる。

30

【0323】

前記の製剤は、一般に活性化合物を0.1から95重量%、好ましくは0.5から90重量%含有する。

【0324】

本発明の活性化合物は、これ自体で又はこの製剤で、雑草防除の目的に公知の除草剤及び／又は作物植物の耐性を向上させる物質（「薬害軽減剤」）との混合物として使用でき、レディーミックス又はタンクミックスが可能である。従って、1種又はそれ以上の公知の除草剤を含有する除草剤製品と薬害軽減剤との混合物も可能である。

40

【0325】

前記混合物に適している除草剤は、公知の除草剤、例えば、アセトクロール、アシフルオルフェン（ナトリウム）、アクロニフェン、アラクロール、アロキシジム（ナトリウム塩）、アメトリン、アミカルバゾン、アミドクロール、アミドスルフロン、アニロホス、アシュラム、アトラジン、アザフェニジン、アジムスルフロン、ベフルブタミド、ベナゾリン（－エチル）、ベンフレセート、ベンスルフロン（－メチル）、ペンタゾン、ベンゾフェンジゾン（benz f e n d i z o n e）、ベンゾビシクロン、ベンゾフェナップ、ベンゾイルプロップ（－エチル）、ピアラホス、ピフェノックス、ビスピリバック（ナトリウム塩）、プロモブチド、プロモフェノキシム、プロモキシニル、ブタクロール、ブタ

50

フェナシル（－アリル）、ブトロキシジム、ブチレート、カフェンストロール、カロキシ
 ジム（caloxydim）、カルベタミド、カルフェントラゾン（－エチル）、クロメ
 トキシフェン、クロルアンベン、クロリダゾン、クロリムロン（－エチル）、クロルニト
 ロフェン、クロルスルフロン、クロルトルロン、シニドン（－エチル）、シンメチリン、
 シノスルフロン、クレフォキシジム（clefoxydim）、クレトジム、クロジナホ
 ップ（－プロパルギル）、クロマゾン、クロメプロップ、クロピラリド、クロピラスルフ
 ロン（－メチル）、クロランスラム（－メチル）、クミルロン、シアナジン、シブトリ
 ン（cybutryne）、シクロエート、シクロスルファミロン、シクロキシジム、シハ
 ロホップ（－ブチル）、2, 4-D、2, 4-DB、デスメディファミン、ジアレート、ジ
 カンバ、ジクロルプロップ（－P）、ジクロホップ（－メチル）、ジクロスラム、ジエタ
 チル（－エチル）、ジフェンゾコート、ジフルフェニカン、ジフルフェンゾピル、ジメフ
 ロン、ジメピレート、ジメタクロール、ジメタメトリン、ジメテナミド、ジメキシフラム
 （dimexyflam）、ジニトラミン、ジフェナミド、ジクワット、ジチオピル、ジ
 ウロン、ダイムロン、エプロポダン（epropodan）、EPTC、エスプロカルブ
 、エタルフルラリン、エタメツルフロン（－メチル）、エトフメセート、エトキシフェン
 （ethoxyfen）、エトキシスルフロン、エトベンズアニド、フェノキサプロップ
 （－P－エチル）、フェントラザミド、フラムプロップ（－イソプロピル、－イソプロピ
 ル－L、－メチル）、フラザスルフロン、フロラスラム、フルアジホップ（－P－ブチル）
 、フルアゾレート、フルカルバゾン（－ナトリウム塩）、フルフェナセット、フルメト
 スラム、フルミクロラック（－ペンチル）、フルミオキサジン、フルミプロピン（flu
 mipropyn）、フルメトスラム、フルオメツロン、フルオロクロリドン、フルオロ
 グリコフェン（－エチル）、フルボキサム、フルプロパシル（flupropacil）
 、フルルピルスルフロン（－メチル、－ナトリウム）、フルレノール（－ブチル）、フル
 リドン、フルロキシピル（－ブトキシプロピル、－methyl）、フルルプリミドール
 、フルルタモン（flurtamone）、フルチアセット（－メチル）、フルチアミド
 （fluthiamide）、ホメサフェン、ホラムスルフロン、グルホシネート（アン
 モニウム塩）、グリホセート（イソプロピルアンモニウム塩）、ハロサフェン、ハロキシ
 ホップ（－エトキシエチル、－P－メチル）、ヘキサジノン、イマダメタベンズ（－メチ
 ル）、イマゼメタピル、イマザモックス、イマザピック、イマザピル、イマザキン、イマ
 ゼタピル、イマゾスルフロン、イオドスルフロン（－メチル、－ナトリウム）、アイオキ
 シニル、イソプロパリン、イソプロツロン、イソウロン、イソキサベン、イソキサクロル
 トール、イソキサフルトール、イソキサピリフォップ（isoxapyrifop）、ラ
 クトフェン、レナシル、リニユロン、MCPA、メコプロップ、メフェナセット、メソト
 リオン、メタミトロン、メタザクロル、メタベンズチアズロン、メトベンズロン、メトブ
 ロムロン、（α－）メトラクロール、メトスラム、メトキスロン、メトリブジン、メトス
 ルフロン（－メチル）、モリネート、モノリニユロン、ナプロアニリド、ナプロパミド、
 ネブロン、ニコスルフロン、ノルフルラゾン、オルベンカルブ、オリザリン、オキサジア
 ルギル、オキサジアゾン、オキサスルフロン、オキサジクロメホン、オキシフルオルフェ
 ン、パラコート、ペラルゴン酸、ペンジメタリン、ペンドラリン（pendralin）
 、ペントキサゾン、フェンメディファミン、ピコリナフェン、ピペロホス、プレチラクロ
 ル、プリミスルフロン（－メチル）、プロフルアゾール（proflumazone）、プロ
 メトリン、プロパクロール、プロパニル、プロパキサロホップ、プロップイソクロール（
 propisochlor）、プロボキシカルバゾン（propoxycarbazon
 e）（ナトリウム塩）、プロピザミド、プロスルホカルブ、プロスルフロン、ピラフルフ
 ェン（－エチル）、ピラゾギル（pyrazogyl）、ピラゾレート、ピラゾスルフロ
 ン（－エチル）、ピラゾキシフェン、ピリベンゾキシム（pyribenzoxim）、
 ピリブチカルブ、ピリデート、ピリダトール（pyridatol）、ピリフタリド、ピ
 リミノバック（－メチル）、ピリチオバック（ナトリウム塩）、キンクロラック、キンメ
 ラック（quinmerac）、キノクラミン、キザロホップ（－P－エチル、－P－テ
 フリル）、リムスルフロン、セトキシジム、シマジン、シメトリン、スルコトリオン（s

10

20

30

40

50

ulcotri one)、スルフェントラゾン、スルホメツロン(一メチル)、スルホセート、スルホスルフロ、テブタン、テブチウロン、テブラロキシジム、テルブチラジン、テルブトリン、テニクロール、チアフルアミド(thiafluamide)、チアゾピル、チジアジミン(thidiazimin)、チフェンスルフロ(一メチル)、チオベンカルブ、チオカルバジル、トラルコキシジム、トリアレート、トリアスルフロ、トリベヌロン(一メチル)、トリクロピル、トリジファン、トリフルラリン、トリフロキシスルフロ、トリフルスルフロ(一メチル)、トリトスルフロである。

【0326】

また、前記混合物に適したものは、公知の薬害軽減剤、例えば：AD-67、BAS-145138、ベノキサコール、クロキントセット(一メキシル)、シオメトリニル(cyometrinil)、2,4-D、DKA-24、ジクロルミド、ダイムロン、フェンクロリム、フェンクロラゾール(一エチル)、フルラゾール、フルキソフェニム(fluxofenim)、フルリラゾール、イソキサジフェン(一エチル)、MCPA、メコプロップ(-P)、メフェンピル(一ジエチル)、MG-191、オキサベトリニル、PPG-1292、R-29148である。

【0327】

他の公知の活性化合物、例えば殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、鳥類忌避剤、植物栄養剤及び土壌改良剤との混合物も可能である。

【0328】

本発明の活性化合物は、これ自体で利用できるし、又はこの製剤の形態で又はこれからさらに希釈することによって調製される使用形態で、例えばすぐ使用できる溶液、懸濁液、乳濁液、粉剤、ペースト剤及び粒剤で利用できる。これらは、慣用の方法で、例えば、散水、散布、噴霧又は散播によって使用する。

【0329】

本発明の活性化合物は、植物の発芽前及び発芽後の両方に施用できる。該化合物は播種前の土壌に含浸させることもできる。

【0330】

活性化合物の施用量は、比較的広い範囲内で変化させることができる。本質的に、この量は所望の効果の性質に依存する。一般的に、施用量は、土壌面積1ヘクタール当たり1gから10kg、好ましくは5gから5kg/haである。

【0331】

本発明の物質は、強い殺微生物活性を有し、植物保護及び材料保護において真菌類及び細菌類などの望ましくない微生物の防除に使用し得る。

【0332】

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

【0333】

殺細菌剤は、作物保護においてシュードモナス科(Pseudomonadaceae)、リゾビウム科(Rhizobiaceae)、腸内細菌科(Enterobacteriaceae)、コリネバクテリア科(Corynebacteriaceae)及びストレプトマイセス科(Streptomycetaceae)の細菌を防除するのに用いることができる。

【0334】

前記に挙げた属名に入る真菌性及び細菌性の病気を引き起こすある種の病原体を例として挙げるが、これらに限定されるものではない：

キサントモナス(Xanthomonas)種、例えばイネ白葉枯病菌(Xanthomonas campestris pv. oryzae)；

シュドモナス (Pseudomonas) 種、例えばウリ科植物の斑点細菌病菌 (Pseudomonas syringae pv. lachrymans) ;

エルウィニア (Erwinia) 種、例えば火傷病菌 (Erwinia amylovora) ;

フハイカビ (Pythium) 種、例えば苗腐敗病菌 (Pythium ultimum) ;

疫病菌 (Phytophthora) 種、例えばトマト、ジャガイモの疫病菌 (Phytophthora infestans) ;

ニセツユカビ (Pseudoperonospora) 種、例えばホップ疫病菌 (Pseudoperonospora humuli) 又はウリ科植物のべと病菌 (Pseudoperonospora cubensis) ;

10

タンジクツユカビ (Plasmopara) 種、例えばブドウのべと病 (Plasmopara viticola) ;

ブレミア (Bremia) 種、例えばレタスべと病菌 (Bremia lactucae) ;

ツユカビ (Peronospora) 種、例えばエンドウべと病菌 (Peronospora pisi) 又はナタネべと病菌 (P. brassicae) ;

ウドンコカビ (Erysiphe) 種、例えばオオムギうどんこ病菌 (Erysiphe graminis) ;

スファエロセカ (Sphaerotheca) 種、例えばうどんこ病菌 (Sphaerotheca fuliginea) ;

20

ポドスフェラ (Podosphaera) 種、例えばリンゴうどんこ病菌 (Podosphaera leucotricha) ;

ベンツリア (Venturia) 種、例えばリンゴ黒星病菌 (Venturia inaequalis) ;

ピレノホーラ (Pyrenophora) 種、例えばオオムギの網斑病菌 (Pyrenophora teres) 又は斑葉病菌 (P. graminea) [分生胞子体: Drechslera 属菌、syn: ヘルミントスポリウム (Helminthosporium) 属菌] ;

コクリオボルス (Cochliobolus) 種、例えばムギ類斑点病菌 (Cochliobolus sativus) [分生胞子体: Drechslera 属菌、syn: ヘルミントスポリウム (Helminthosporium) 属菌] ;

30

ウロミセス (Uromyces) 種、例えばマメ類さび病菌 (Uromyces appendiculatus) ;

プクキニア (Puccinia) 種、例えばコムギ、ライムギの赤さび病菌 (Puccinia recondita) ;

スクレロチニア (Sclerotinia) 種、例えば菌核病菌 (Sclerotinia sclerotiorum) ;

チレチア (Tilletia) 種、例えばコムギなまぐさ黒穂病菌 (Tilletia caries) ;

40

クロボキン (Ustilago) 種、例えばオオムギ裸黒穂病菌 (Ustilago nuda) 又はエンバク裸黒穂病菌 (Ustilago avenae) ;

ペリキュラリア (Pellicularia) 種、例えばイネ紋枯病菌 (Pellicularia sasakii) ;

ピリキュラリア (Pyricularia) 種、例えばイネいもち病菌 (Pyricularia oryzae) ;

フザリウム (Fusarium) 種、例えばフザリウム・クルモラム (Fusarium culmorum) ;

ボトリチス (Botrytis) 種、例えば灰色かび病菌 (Botrytis cinerea) ;

50

セプトリア (Septoria) 種、例えばコムギふ枯病菌 (Septoria nodorum) ;

レプトスフェリア (Leptosphaeria) 種、例えばコムギふ枯病菌 (Leptosphaeria nodorum) ;

セルコスポラ (Cercospora) 種、例えば褐斑病菌 (Cercospora canescens) ;

アルタナリア (Alternaria) 種、例えばナタネ黒斑病 (Alternaria brassicae) ; 及び

シュードセルコスポレラ (Pseudocercospora) 種、例えばコムギ眼紋病菌 (Pseudocercospora herpotrichoides) 。

10

【0335】

本発明の活性化化合物はまた、植物において極めて良好な強化効果も有する。従って、本発明の活性化化合物は、望まれていない微生物による襲撃に対して植物の防御手段を結集するのに適している。

【0336】

本明細書において、植物強化（抵抗性誘導性）物質とは、処理植物にこの後に望まれていない微生物を接種した場合に、処理植物がこれらの微生物に対して十分な抵抗性を示すように植物の防御系を刺激することができる物質であると解釈されるべきである。

【0337】

20

この場合に、望ましくない微生物とは、植物病原性の真菌、細菌及びウイルスであると解釈されるべきである。従って、本発明の物質は、処理後のある一定の期間、前記の病原体による攻撃から植物を保護するのに使用できる。この保護が提供される期間は、前記活性化化合物を用いて植物を処理した後、一般的には1から10日間、好ましくは1から7日間に及ぶ。

【0338】

本発明の活性化化合物が植物の病害を防除するのに必要な濃度で植物によって十分に許容されるということは、植物の地上部分、繁殖ストック及び種子、並びに土壌の処理を可能にする。

【0339】

30

本発明の活性化化合物はまた、作物の収量を高めるのに適している。また、本発明の活性化化合物は低下した毒性を有し、植物に十分に許容される。

【0340】

ある一定の濃度及び施用量で、本発明の活性化化合物は、適切ならば、除草剤として植物の成長に影響を及ぼすために及び動物害虫を防除するために使用することもできる。適切ならば、本発明の活性化化合物はまた、別の活性化化合物の合成用の中間体及び前駆物質として使用できる。

【0341】

材料の保護において、本発明の化合物は、望まれていない微生物による感染及び破壊から工業資材を保護するのに使用できる。

40

【0342】

本明細書では工業資材とは、工業で使用するために製造された無生物材料と意味すると解釈される。例えば、本発明の有効成分によって微生物による変質又は破壊から保護することを目的とする工業資材は、接着剤、糊、紙及び厚紙、織物、皮革、木材、塗料及びプラスチック製品、冷却潤滑剤、並びに微生物が感染又は破壊し得る他の材料である。微生物の増殖によって損傷し得る製造装置の部品、例えば冷却水循環路もまた、保護すべき材料の範囲内に挙げ得る。本発明の範囲に挙げ得る工業資材としては、好ましくは接着剤、糊、紙及び厚紙、皮革、木材、塗料、冷却潤滑剤及び熱媒液が挙げられ、特に好ましくは木材が挙げられる。

【0343】

50

挙げ得る工業資材を分解又は変化させ得る微生物としては、例えば細菌、真菌（カビ菌）、酵母、藻類及びスライム生物が挙げられる。本発明の活性化合物は、真菌（カビ菌）、特に糸状菌、木材変色菌及び木材腐朽菌（担子菌類）に対して及びスライム生物及び藻類に対して作用することが好ましい。

【0344】

下記の属の微生物を例として挙げ得る：

アルタナリア属 (Alternaria)、例えばアルタナリア・テヌイス (Alternaria tenuis)、

アスペルギルス属 (Aspergillus)、例えばアスペルギルス・ニガー (Aspergillus niger)、

ケトミウム属 (Chaetomium)、例えばケトミウム・グロボーサム (Chaetomium globosum)、

コニオホーラ (Coniophora) 属、例えばコニオホーラ・プエタナ (Coniophora puetana)、

レンティナス (Lentinus) 属、例えばレンティナス・チグリヌス (Lentinus tigrinus)、

ペニシリウム (Penicillium) 属、例えばペニシリウム・グラウカム (Penicillium glaucum)、

ポリポルス (Polyporus) 属、例えばポリポルス・バージカラー (Polyporus versicolor)、

アウレオバシジウム (Aureobasidium) 属、例えばアウレオバシジウム・プルランス (Aureobasidium pullulans)、

スクレロフォーマ (Sclerophoma) 属、例えばスクレロフォーマ・ピティオフィラ (Sclerophoma pityophila)、

トリコデルマ (Trichoderma) 属、例えばトリコデルマ・ヴィリデ (Trichoderma viride)、

エシェリキア (Escherichia) 属、例えば大腸菌 (Escherichia coli)、

シュードモナス (Pseudomonas) 属、例えば緑膿菌 (Pseudomonas aeruginosa)、

ブドウ球菌 (Staphylococcus) 属、例えば黄色ブドウ球菌 (Staphylococcus aureus)。

【0345】

本発明の活性化合物は、この個々の物理的及び／又は化学的性質に応じて、慣用の製剤、例えば液剤、乳剤、懸濁剤、粉剤、発泡剤、ペースト剤、粒剤、エーロゾル並びに高分子物質及び種子用被覆化合物中の微細カプセル剤に変え得、またULV冷及び加温煙霧製剤に変え得る。

【0346】

これらの製剤は、公知の方法で、例えば活性化合物を増量剤、すなわち液状溶媒、加圧液化ガス、及び／又は固形担体と、場合によっては界面活性剤、すなわち乳化剤及び／又は分散剤及び／又は泡形成剤と混合することにより製造される。使用される増量剤が水である場合には、例えば有機溶媒を補助溶媒として使用し得る。本質的には、適切な液状溶媒は、芳香族炭化水素、例えばキシレン、トルエン又はアルキルナフタレン、塩素化芳香族炭化水素又は塩素化脂肪族炭化水素、例えばクロロベンゼン、クロロエチレン又は塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えばシクロヘキサン又はパラフィン類、例えば石油留分、アルコール類、例えばブタノール又はグリコール及びこれらのエーテル及びエステル、ケトン類、例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えばジメチルホルムアミド及びジメチルスルホキシド、並びに水である。液化ガス状増量剤又は担体とは、標準温度及び標準圧力でガス状である液体、例えばエーロゾル噴射剤、例えばハロゲン化炭化水素並びにブタン、プロパン、窒素及び

二酸化炭素を意味すると解釈されるべきである。適切な固形担体は、例えば粉碎天然鉱物、例えばカオリン、クレー、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイト又はケイソウ土並びに粉碎合成鉱物、例えば微細ケイ酸、アルミナ及びケイ酸塩である。粒剤に適した固形担体は、例えば破碎及び分別天然石、例えば方解石、軽石、大理石、海泡石及びドロマイト又は無機及び有機粉末から調製される合成顆粒、並びに有機材料例えばおが屑、ヤシ殻、トウモロコシの穂軸及びタバコの茎の顆粒である。適切な乳化剤及び／又は泡形成剤は、例えば非イオン性乳化剤及び陰イオン性乳化剤、例えばポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル、例えばアルキルアリールポリグリコールエーテル、アルキルスルホン酸塩、アルキル硫酸塩、アリールスルホン酸塩及びタンパク質加水分解生成物である。適切な分散剤は、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。

10

【0347】

粘着付与剤、例えばカルボキシメチルセルロース並びに粉末状、顆粒状又はラテックス状の天然及び合成重合体、例えばアラビアゴム、ポリビニルアルコール、ポリ酢酸ビニル、又は天然リン脂質、例えばセファリン類及びレシチン類、及び合成リン脂質が、製剤に使用し得る。他の添加剤は、鉱油及び植物油であり得る。

【0348】

着色剤、例えば無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタン、プルシアンブルー、及び有機染料、例えばアリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料並びに微量栄養素、例えば鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデン及び亜鉛の塩を使用することができる。

20

【0349】

前記の製剤は、活性化化合物を一般的に0.1から95重量%、好ましくは0.5から90重量%含有する。

【0350】

本発明の活性化化合物は、このままで又はこの製剤で使用してもよいし、また公知の殺菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺虫剤との混合物で使用して、例えば活性スペクトルを広げるか又は抵抗性の発現を防止し得る。多くの場合、相乗効果がこの場合に得られる、すなわち混合物の活性がこの個々成分の活性よりも高い。

【0351】

30

適切な混合成分の例は、下記の通りである：

殺菌剤：

2-フェニルフェノール；8-ヒドロキシキノリンサルフェート；アシベンゾラルーS-メチル；アルジモルフ；アミドフルメト；アムプロピルホス；アムプロピルホス・カリウム；アンドプリム（andoprime）；アニラジン；アザコナゾール；アゾキシストロビン；ベナラキシル；ベノダニル；ベノミル；ベンチアバリカルブ・イソプロピル；ベンザマクリル；ベンザマクリル・イソブチル；ビラナホス；ビナバクリル；ビフェニル；ビテルタノール；ブラストサイジン・S；ブロムコナゾール；ブピリメート；ブチオベート；ブチルアミン；多硫化石灰；カプシマイシン（capsimycin）；カプタホル；キャプタン；カルベンダジム；カルボキシシン；カルプロパミド；カルボン；キノメチオナート；クロベンチアゾン；クロルフエナゾール；クロロネブ；クロロタロニル；クロゾリネート；クロジラコン；シアゾファミド；シフルフェナミド；シモキサニル；シプロコナゾール；シプロジニル；シプロフラム；Dagger G；デバカルブ；ジクロフルアニド；ジクロン；ジクロロフェン；ジクロシメット；ジクロメジン；ジクロラン；ジエトフェンカルブ；ジフェノコナゾール；ジフルメトリム；ジメチリモール；ジメトモルフ；ジモキシストロビン；ジニコナゾール；ジニコナゾール-M；ジノカップ；ジフェニルアミン；ジピリチオン；ジタリムホス；ジチアノン；ドジン；ドラゾキソロン；エジフェンホス；エポキシコナゾール；エタボキサム；エチリモール；エトリジアゾール；ファモキサドン；フェナミドン；フェナパニル；フェナリモール；フェンブコナゾール；フェンフラム；フェンヘキサミド；フェニトロパン；フェノキサニル；フェンピクロニル；フェ

40

50

ンプロピジン；フェンプロピモルフ；ファーバム；フルアジナム；フルベンジミン；フル
 ジオキソニル；フルメトオーバー（flumet over）；フルモルフ（flumor
 ph）；フルオロミド；フルオキサストロビン；フルキンコナゾール；フルルプリミドール；フルシラゾール；フルスルファミド；フルトラニル；フルトリアホール；フォルベッ
 ト；ホセチル・アルミニウム；ホセチル・ナトリウム；フベリダゾール；フララキシル；
 フラメトピル；フルカルバニル；フルメシクロックス；グアザチン；ヘキサクロロベンゼン；ヘキサコナゾール；ヒメキサゾール；イマザリル；イミベンコナゾール；イミノクタ
 ジン三酢酸塩；イミノクタジン三アルベシル酸塩；ヨードカルブ；イブコナゾール；イブ
 ロベンホス；イブプロジオン；イブプロバリカルブ；イルママイシン；イソプロチオラン；イ
 ソバレジオン；カスガマイシン；クレソキシム・メチル；マンコゼブ；マネブ；メフェリ
 ムゾン；メパニピリム；メプロニル；メタラキシル；メタラキシル・M；メトコナゾール
 ；メタスルホカルブ；メトフロキサム；メチラム；メトミノストロビン；メトスルホバク
 クス（met sulf o v a x）；ミルディオマイシン；マイクロブタニル；マイクロゾ
 リン；ナタマイシン；ニコビフェン（nicobi fen）；ニトロタル・イソプロピル
 ；ノピフルムロン；ヌアリモール；オフレース；オリサストロビン；オキサジキシル；オ
 キソリン酸；オキシポコナゾール；オキシカルボキシ；オキシフェンチイン（oxyf
 enthi in）；パクロブトラゾール；ペフラゾエート；ペンコナゾール；ペンシクロ
 ン；ホスダイフェン；フサライド；ピコシキストロビン；ピペラリン；ポリオキシシ
 ン類；ポリオキシソリム（polyoxorim）；プロベナゾール；プロクロラズ；プロシミド
 ン；プロパモカルブ；プロパノシン（propanosine）・ナトリウム；プロピコ
 ナゾール；プロピネブ；プロキナジッド（proquinazid）；プロチオコナゾール
 ；ピラクロストロビン；ピラゾホス；ピリフェノックス；ピリメタニル；ピロキロン；
 ピロキシフル；ピロールニトリン；キンコナゾール；キノキシフェン；キントゼン；シメ
 コナゾール；スピロキサミン；硫黄；テブコナゾール；テクロフタラム；テクナゼン；テ
 トシクラシス；テトラコナゾール；チアベンダゾール；チシオフエン（thicyofe
 n）；チフルザミド；チオフアネート・メチル；チラム；チオキシミド；トルクロホス・
 メチル；トリルフルアニド；トリアジメホン；トリアジメノール；トリアズブチル；トリ
 アゾキシド；トリシクラミド；トリシクラゾール；トリデモルフ；トリフロキシストロビ
 ン；トリフルミゾール；トリホリン；トリチコナゾール；ウニコナゾール；バリダマイシ
 ンA；ピンクロゾリン；ジネブ；ジラム；ゾキサミド；（2S）-N-[2-[4-[
 3-(4-クロロフェニル)-2-プロピニル]オキシ]-3-メトキシフェニル]エチ
 ル]-3-メチル-2-[(メチルスルホニル)アミノ]ブタンアミド；1-(1-ナフ
 タレニル)-1H-ピロール-2, 5-ジオン；2, 3, 5, 6-テトラクロロ-4-(
 メチルスルホニル)ピリジン；2-アミノ-4-メチル-N-フェニル-5-チアゾール
 カルボキサミド；2-クロロ-N-(2, 3-ジヒドロ-1, 1, 3-トリメチル-1H-
 インデン-4-イル)-3-ピリジニルカルボキサミド；3, 4, 5-トリクロロ-2,
 6-ピリジンジカルボニトリル；アクチノベート（actinovate）；シス-1-
 (4-クロロフェニル)-2-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)シクロヘ
 プタノール；1-(2, 3-ジヒドロ-2, 2-ジメチル-1H-インデン-1-イル)
 -1H-イミダゾール-5-カルボン酸メチル；炭酸水素カリウム；N-(6-メトキシ
 -3-ピリジニル)-シクロプロパンカルボキサミド；N-ブチル-8-(1, 1-ジメ
 チルエチル)-1-オキサスピロ[4. 5]デカン-3-アミン；テトラチオカルボン酸
 ナトリウム；並びに銅塩及び銅製剤、例えばボルドー液；水酸化銅；ナフテン酸銅；オキ
 シ塩化銅；硫酸銅；クフラネブ；亜酸化銅；マンカップー；オキシ銅。

殺細菌剤：

ブロモポール、ジクロロフェン、ニトラピリン、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル
 、カスガマイシン、オクチリノン、フランカルボン酸、オキシテトラサイクリン、プロベ
 ナゾール、ストレプトマイシン、テクロフタラム、硫酸銅及び他の銅製剤。

殺虫剤／殺ダニ剤／殺線虫剤：

アバメクチン、ABG-9008、アセフェート、アセキノシル、アセタミプリド、ア

10

20

30

40

50

セトプロール、アクリナトリン、AKD-1022、AKD-3059、AKD-3088、アラニカルブ、アルジカルブ、アルドキシカルブ、アレスリン、アレスリン1R-異性体、 α -シペルメトリン（アルファメトリン）、アミドフルメト、アミノカルブ、アミトラズ、アバメクチン、AZ-60541、アザジラクチン、アザメチホス、アジンホス・メチル、アジンホス・エチル、アゾシクロチン、

バチルス・ポピリエ (Bacillus popilliae)、バチルス・スフェリカス (Bacillus sphaericus)、枯草菌 (Bacillus subtilis)、バチルス・スリンジエンシス (Bacillus thuringiensis)、バチルス・スリンジエンシス株EG-2348、バチルス・スリンジエンシス株GC-91、バチルス・スリンジエンシス株NCTC-11821、バキュロウイルス、ボーベリア・バシアーナ (Beauveria bassiana)、ボーベリア・テネラ (Beauveria tenella)、ベンダイオカルブ、ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ベンゾキシメート、 β -シフルトリン、 β -シペルメトリン、ビフェナゼート、ビフェントリン、ピナバクリル、ビオアレスリン、ビオアレスリン-S-シクロペンチル異性体、ビオエタノメトリン、ビオペルメトリン、ビオレスメトリン、ビストリフルロン、BPMC、ブロフェンプロックス (b ro f e n p r o x)、ブromoホス・エチル、ブromoプロピレート、ブromフェンビンホス（-メチル）、BTG-504、BTG-505、ブフェンカルブ、ブプロフェジン、ブタチオホス、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、ブチルピリダベン、

カズサホス、カンフェクロル、カルバリル、カルボフラン、カルボフェノチオン、カルボスルファン、カルタップ、CGA-50439、キノメチオネート、クロルデン、クロルジメホルム、クロエトカルブ、クロルエトキシホス、クロルフェナピル、クロルフェンビンホス、クロルフルアズロン、クロルメホス、クロルベンジレート、クロルピクリン、クロルプロキシフェン (c h l o r p r o x y f e n)、クロルピリホス・メチル、クロルピリホス（・エチル）、クロベパトリン (c h l o v a p o r t h r i n)、クロマフェノジド、シス-シペルメトリン、シス-レスメトリン、シス-ペルメトリン、クロシトリン (c l o c y t h r i n)、クロエトカルブ、クロフェンテジン、クロチアニジン、クロチアゾベン (c l o t h i a z o b e n)、コドレモン、クマホス、シアノフェンホス、シアノホス、シクロブレン (c y c l o p r e n e)、シクロプロトリン、シドリンガ (Cydia pomonella)、シフルトリン、シハロトリン、シヘキサチン、シペルメトリン、シフェノトリン（1R-トランス-異性体）、シロマジン、

DDT、デルタメトリン、ジメトン-S-メチル、ジメトン-S-メチルスルホン、ジアフェンチウロン、ジアリホス、ダイアジノン、ジクロフェンチオン、ジクロルボス、ジコホル、ジクロトホス、ジシクラニル、ジフルベンズロン、ジメトエート、ジメチルビンホス、ジノブトン、ジノカップ、ジノテフラン、ジオフェノラン、ジスルホトン、ドクサト-ナトリウム (d o c u s a t e - s o d i u m)、ドフェナピン (d o f e n a p y n)、DOWCO-439、

エフルシラネート (e f l u s i l a n a t e)、エマメクチン、エマメクチン安息香酸塩、エンペントリン（1R-異性体）、エンドスルファン、接合菌エントモフソーラ種 (Entomophthora spp.)、EPN、エスフェンバレレート、エチオフェンカルブ、エチプロール、エチオン、エトプロホス、エトフェンプロックス、エトキサゾール、エトリムホス、

ファミフル、フェナミホス、フェナザキン、酸化フェンブタスズ、フェンフルトリン、フェニトロチオン、フェノブカルブ、フェノチオカルブ、フェノキサクリム、フェノキシカルブ、フェンプロパトリン、フェンピラド、フェンピリトリン、フェンピロキシメート、フェンスルホチオン、フェンチオン、フェントリファニル、フェンバレレート、フィプロニル、フロニカミド、フルアクリプリム、フルアズロン、フルベンジミン、フルプロシトリネート、フルシクロクスロン (f l u c y c l o x u r o n)、フルシトリネート、フルフェネリム、フルフェノクスロン、フルフェンプロックス、フルメトリン、フルピラゾホス、フルテンジン (f l u t e n z i n e) [フルフェンジン (f l u f e n z i n

10

20

30

40

50

e)〕、フルバリネート、ホノホス、ホルメタネート、ホルモチオン、ホスメチラン、ホスチアゼート、フブフェンプロックス (fubfenprox)〔フルプロキシフェン (fluproxyfen)〕、フラチオカルブ、

γ-HCH、gossyp lure、grand lure、顆粒病ウイルス、
ハルフェンプロックス、ハロフェノジド (halofenozide)、HCH、HCN-801、ヘプテノホス、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾックス、ヒドラメチルノン、
、ハイドロブレン、

IKA-2002、イミダクロプリド、イミプロトリン、インドキサカルブ、ヨードフェンホス、イプロベンホス、イサゾホス、イソフェンホス、イソプロカルブ、イソキサチオン、イベルメクチン、

japonilure、

カデスリン、核多核体病ウイルス、キノブレン、

λ-シハロトリン、リンデン、ルフエヌロン、

マラチオン、メカルバム、メスルフェンホス、メタアルデヒド、メタム・ナトリウム、メタクリホス、メタミドホス、メタリジウム・アニソプリエ (Metharhizium anisopliae)、メタリジウム・フラボビリデ (Metharhizium flavoviride)、メチダチオン、メチオカルブ、メソミル、メトブレン、メトキシクロル、メトキシフェノジド、メトルカルブ、メトキサジアゾン、メビンホス、ミルベメクチン、ミルベマイシン、MKI-245、MON-45700、モノクロトホス、モキシデクチン、MTI-800、

ナレッド、NC-104、NC-170、NC-184、NC-194、NC-196、ニクロサミド、ニコチン、ニテンピラム、ニチアジン、NNI-0001、NNI-0101、NNI-0250、NNI-9768、ノバルロン、ノビフルムロン、

OK-5101、OK-5201、OK-9601、OK-9602、OK-9701、OK-9802、オメトエート、オキサミル、オキシジメトン・メチル、

ペシロマイセス・フモソロセウス (Paecilomyces fumosoroseus)、パラチオン・メチル、パラチオン (・エチル)、ペルメトリン (シス、トランス)、マシン油、PH-6045、フェノトリン (1R-トランス異性体)、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホスホカルブ、ホキシム、ピペロニルブトキシド、ピリミカーブ、ピリミホス・メチル、ピリミホス・エチル、プラレスリン、プロフェノホス、プロメカルブ、プロパホス、プロパルギット、プロペタムホス (propetamphos)、プロポキスル、プロチオホス、プロトエート、プロトリフェンブテ (protрифенbutе)、ピメトロジン、ピラクロホス、ピレスメトリン、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリダフェンチオン、ピリダチオン、ピリミジフェン、ピリプロキシフェン、

キナルホス、

レスメトリン、RH-5849、リバビリン、RU-12457、RU-15525、S-421、S-1833、サリチオン、ブチルフォス、SI-0009、シラフルオフエン、スピノサド、スピロジクロフェン、スピロメシフェン (spiro mesifen)、スルフラミド、スルホテップ、スルプロホス、SZI-121、

タウ-フルバリネート、テブフェノジド、テブフェンピラド、テブピリミホス、テフルベンズロン、テフルトリン、テメホス、テミビンホス、ターバム、テルブホス、テトラクロルビンホス、テトラジホン、テトラメトリン、テトラメトリン (1R-異性体)、テトラサル、θ-シペルメトリン、チアクロプリド、チアメトキサム、チアプロニル、チアトリホス (thiatriphos)、チオシクラムシュウ酸塩、チオジカルブ、チオファノックス、チオメトン、チオサルタップ・ナトリウム (thiosultap-sodium)、スリンジエンシン (thuringiensin)、トルフェンピラド、トラロシトリン、トラロメトリン、トランスフルトリン、トリアラセン、トリアザメート、トリアゾホス、トリアズロン (triazuron)、トリクロフェニジン、トリクロルホン、トリフルムロン、トリメタカルブ、

10

20

30

40

50

バミドチオン、バニリプロール (*vaniliprole*)、ベルブチン (*verbutin*)、バーティシリウム・レカニ (*Verticillium lecanii*)、
 WL-108477、WL-40027、
 YI-5201、YI-5301、YI-5302、
 XMC、キシリルカルブ、
 ZA-3274、ゾーシペルメトリン、ゾラプロホス (*zolapropos*)、ZX
 I-8901、

化合物 プロピルカルバミン酸 3-メチルフェニル (ツマサイド Z)、

化合物 3-(5-クロロ-3-ピリジニル)-8-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-3-カルボニトリル (CAS-Reg
 . No. 185982-80-3) 及び対応する 3-エンド-異性体 (CAS-Reg.
 No. 185984-60-5) (国際公開第 WO 96/37494 号公報、同第 WO 9
 8/25923 号公報参照)、

並びに殺虫活性植物抽出物、線虫、真菌又はウイルスを含有する製剤。

【0352】

除草剤などの他の公知の活性化合物との混合物又は肥料及び生長調節剤の混合物も可能である。

【0353】

また、本発明の式 (I) の化合物は、極めて良好な抗真菌活性も有する。該化合物は、特に皮膚糸状菌及び酵母、糸状菌及び二相性真菌 [例えば、カンジダ種、例えばカンジダ・アルビカンス (*Candida albicans*)、カンジダ・グラブラータ (*Candida glabrata*)]、並びにエピデルモフィトン・フロッコズム (*Epidermophyton floccosum*)、アスペルギルス種例えばアルベルギルス・ニガー (*Aspergillus niger*) 及びアルベルギルス・フミガーツス (*Aspergillus fumigatus*)、白癬菌種例えばトリコフィトン・メンタグロフィテス (*Trichophyton mentagrophytes*)、ミクロスポルム種、例えばミクロスポルム・カニス (*Microsporum canis*) 及びミクロスポルム・オーズアニー (*Microsporum audouinii*) に対して極めて広い抗真菌活性スペクトルを有する。これらの真菌類のリストは、含み得る真菌スペクトルの限定を示すものではなく、むしろ単なる例示のためのものである。

【0354】

本発明の活性化合物は、このままで施用できるし、この製剤の形態又はこれから調製される施用形態、例えばすぐ使用可能な液剤、懸濁剤、水和剤、ペースト剤、水溶剤、粉剤及び粒剤の形態で施用できる。施用は、慣用の方法で、例えば注入、噴霧、散布、散粉、発泡、塗布などにより実施される。また、活性化合物を微量散布法によって施用することが可能であるし、又は有効成分製剤又は有効成分これ自体を土壌に注入することも可能である。また、植物の種子も処理することが可能である。

【0355】

本発明の活性化合物を殺菌剤として使用する場合には、この施用量は施用の種類に応じて広い範囲内で変化させることができる。植物の部分の処理については、活性化合物の施用量は、一般的には 0.1 から 10,000 g/h a、好ましくは 10 から 1,000 g/h a である。種子粉衣については、活性化合物の施用量は、一般的には 種子 1 kg 当たり 0.001 から 50 g、好ましくは種子 1 kg 当たり 0.01 から 10 g である。土壌の処理については、活性化合物の施用量は、一般的には 0.1 から 10,000 g/h a、好ましくは 1 から 5,000 g/h a である。

【実施例】

【0356】

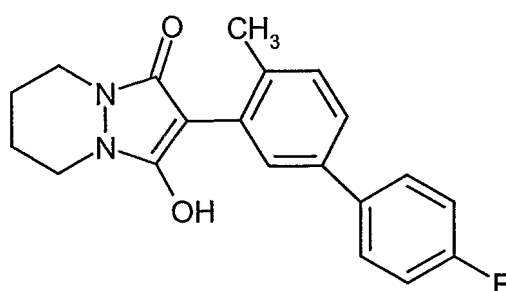
本発明の活性化合物の製造及び使用を、以下の実施例により例証する。

製造実施例

実施例 (I-1-a-1)

【0357】

【化99】



10

【0358】

実施例V-1の化合物3. 1g (8.0ミリモル)を無水ジメチルホルムアミド(DMF)40mlに溶解し、10℃で、カリウムtert-ブトキシド1.08g(9.6ミリモル)をアルゴン雰囲気下で加えた。混合物を室温で12時間攪拌し、溶媒を減圧下で除去し、残留物を10%水酸化ナトリウム水溶液150mlに溶解した。得られた混合物を塩化メチレンで3回抽出し、水性相を氷浴を用いて冷却しながら、2N塩酸で酸性化した。この酸性溶液を塩化メチレンで3回抽出し、有機相を一緒にして水で1回洗浄し、次いで硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を減圧下で除去し、次いで残留物をエーテルで結晶化させ、吸引濾過し、風乾した。

20

【0359】

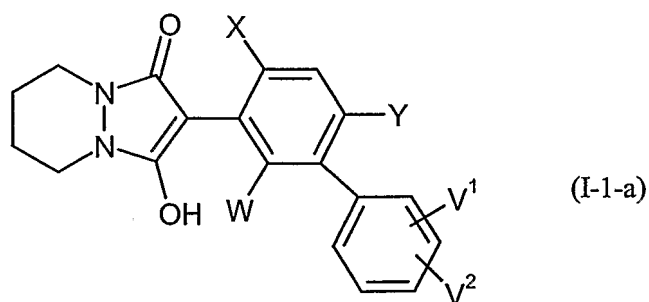
収量: 2.3g (理論値の85%); 無色固体; 温度: 172℃

【0360】

実施例(I-1-a-1)と同様にして及び式(I)の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式(I-1-a)の化合物を得た:

【0361】

【表9】



(I-1-a)

30

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	m. p. (°C)
I-1-a-2	H	CH ₃	H	2-Cl	253
I-1-a-3	H	CH ₃	H	3-Cl	177
I-1-a-4	H	CH ₃	H	4-Cl	206

40

実施例番号	W	X	Y	v ¹ /v ²	m. p. (°C)
I-1-a-5	H	CH ₃	H	2-F	195
I-1-a-6	H	CH ₃	H	3-F	161
I-1-a-1	H	CH ₃	H	4-F	172
I-1-a-7	H	CH ₃	H	2-CH ₃	153
I-1-a-8	H	CH ₃	H	3-CH ₃	173
I-1-a-9	H	CH ₃	H	4-CH ₃	168
I-1-a-10	H	CH ₃	H	2,3-Cl ₂	207
I-1-a-11	H	CH ₃	H	2,4-Cl ₂	161
I-1-a-12	H	CH ₃	H	2,5-Cl ₂	150
I-1-a-13	H	CH ₃	H	3,4-Cl ₂	207
I-1-a-14	H	CH ₃	H	3,5-Cl ₂	196
I-1-a-15	H	CH ₃	H	2,4-F ₂	173
I-1-a-16	H	CH ₃	H	2,5-F ₂	197
I-1-a-17	H	CH ₃	H	3-Cl, 4-F	192
I-1-a-18	H	CH ₃	H	2-CF ₃	142
I-1-a-19	H	CH ₃	H	3-CF ₃	185
I-1-a-20	H	CH ₃	H	4-CF ₃	224
I-1-a-21	H	CH ₃	H	2-OCH ₃	185
I-1-a-22	H	CH ₃	H	3-OCH ₃	135
I-1-a-23	H	CH ₃	H	4-OCH ₃	156
I-1-a-24	H	CH ₃	H	3-SO ₂ C ₂ H ₅	202
I-1-a-25	H	CH ₃	H	4-SO ₂ C ₂ H ₅	197
I-1-a-26	H	CH ₃	H	3-NO ₂	202
I-1-a-27	H	CH ₃	H	4-OCF ₃	151
I-1-a-28	H	CH ₃	H	4-OPh	204
I-1-a-29	H	CH ₃	H	4-SCH ₃	156
I-1-a-30	H	CH ₃	H	4-i-C ₃ H ₇	142
I-1-a-31	H	CH ₃	H	3,5-(CF ₃) ₂	254
I-1-a-32	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-F	Öl
I-1-a-33	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	101
I-1-a-34	CH ₃	CH ₃	H	4-F	246
I-1-a-35	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	240
I-1-a-36	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	> 250

10

20

30

40

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	m. p. (°C)
I-1-a-37	H	Cl	H	4-CF ₃	257
I-1-a-38	H	Cl	H	4-Cl	229
I-1-a-39	H	Cl	H	4-F	187
I-1-a-40	H	Cl	H	3,4-Cl ₂	201
I-1-a-41	H	Cl	H	2,4-Cl ₂	184
I-1-a-42	H	Cl	H	2,4-F ₂	200
I-1-a-43	H	Cl	H	3,5-Cl ₂	256
I-1-a-44	H	Cl	H	4-F, 3-Cl	228
I-1-a-45	H	Cl	H	2,5-Cl ₂	177

10

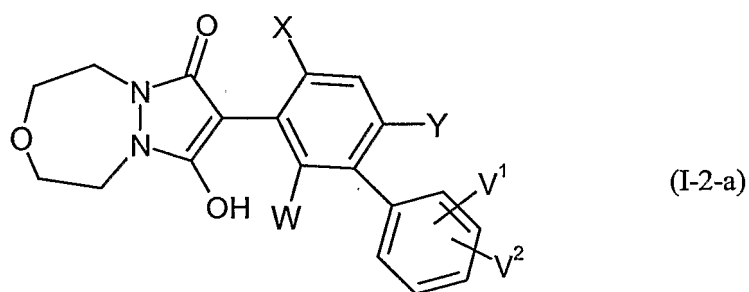
【0362】

実施例（I-1-a-1）と同様にして及び式（I）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（I-2-a）の次の化合物を得た：

【0363】

【表10】

20



30

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	m. p. (°C)
I-2-a-1	H	CH ₃	H	2-Cl	204
I-2-a-2	H	CH ₃	H	3-Cl	167
I-2-a-3	H	CH ₃	H	4-Cl	207
I-2-a-4	H	CH ₃	H	2-F	179
I-2-a-5	H	CH ₃	H	3-F	175
I-2-a-6	H	CH ₃	H	4-F	188
I-2-a-7	H	CH ₃	H	2-CH ₃	172
I-2-a-8	H	CH ₃	H	3-CH ₃	175
I-2-a-9	H	CH ₃	H	4-CH ₃	176
I-2-a-10	H	CH ₃	H	2,3-Cl ₂	192
I-2-a-11	H	CH ₃	H	2,4-Cl ₂	176

40

50

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	m. p. (°C)
I-2-a-12	H	CH ₃	H	2,5-Cl ₂	149
I-2-a-13	H	CH ₃	H	3,4-Cl ₂	191
I-2-a-14	H	CH ₃	H	3,5-Cl ₂	187
I-2-a-15	H	CH ₃	H	2,4-F ₂	191
I-2-a-16	H	CH ₃	H	2,5-F ₂	182
I-2-a-17	H	CH ₃	H	3-Cl, 4-F	201
I-2-a-18	H	CH ₃	H	2-CF ₃	142
I-2-a-19	H	CH ₃	H	3-CF ₃	180
I-2-a-20	H	CH ₃	H	4-CF ₃	221
I-2-a-21	H	CH ₃	H	2-OCH ₃	158
I-2-a-22	H	CH ₃	H	3-OCH ₃	158
I-2-a-23	H	CH ₃	H	4-OCH ₃	186
I-2-a-24	H	CH ₃	H	3-SO ₂ C ₂ H ₅	189
I-2-a-25	H	CH ₃	H	4-SO ₂ C ₂ H ₅	226
I-2-a-26	H	CH ₃	H	3-NO ₂	205
I-2-a-27	H	CH ₃	H	4-OCF ₃	198
I-2-a-28	H	CH ₃	H	4-OPh	226
I-2-a-29	H	CH ₃	H	4-SCH ₃	176
I-2-a-30	H	CH ₃	H	4-i-C ₃ H ₇	170
I-2-a-31	H	CH ₃	H	3,5-(CF ₃) ₂	223
I-2-a-32	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-F	Öl
I-2-a-33	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	185
I-2-a-34	CH ₃	CH ₃	H	4-F	213
I-2-a-35	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	255
I-2-a-36	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	244
I-2-a-37	H	Cl	H	4-CF ₃	251
I-2-a-38	H	Cl	H	4-Cl	227
I-2-a-39	H	Cl	H	4-F	186
I-2-a-40	H	Cl	H	2,4-Cl ₂	192
I-2-a-41	H	Cl	H	3,4-Cl ₂	234
I-2-a-42	H	Cl	H	2,4-F ₂	227
I-2-a-43	H	Cl	H	3,5-Cl ₂	253
I-2-a-44	H	Cl	H	4-F, 3-Cl	234

10

20

30

40

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	m. p. (°C)
I-2-a-45	H	Cl	H	2,5-Cl ₂	198

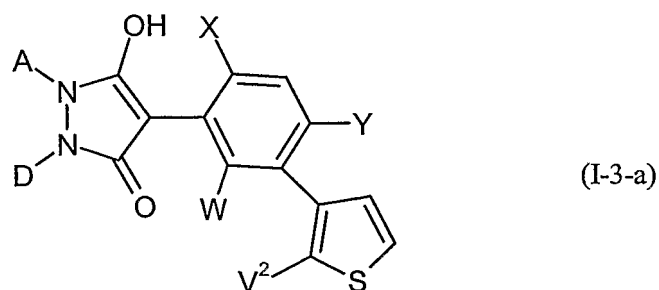
【0364】

実施例（I-1-a-1）と同様にして及び式（I）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（I-3-a）の化合物を得た：

【0365】

【表11】

10



実施例番号	W	X	Y	V ²	A	D	m. p. °C
I-3-a-1	H	CH ₃	H	H	-(CH ₂) ₄ -		162
I-3-a-2	H	CH ₃	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂		173

20

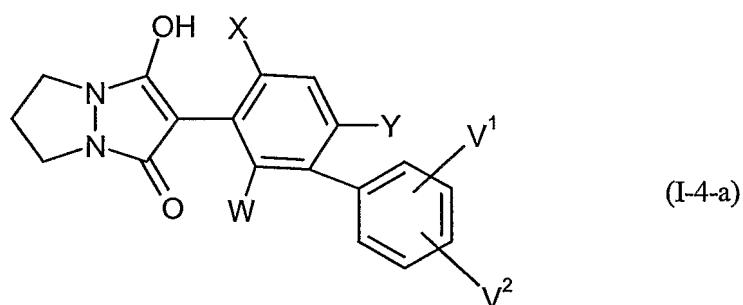
【0366】

実施例（I-1-a-1）と同様にして及び式（I）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（I-4-a）の化合物を得た：

【0367】

【表12】

30



実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	m. p. °C
I-4-a-1	H	CH ₃	H	4-F	151

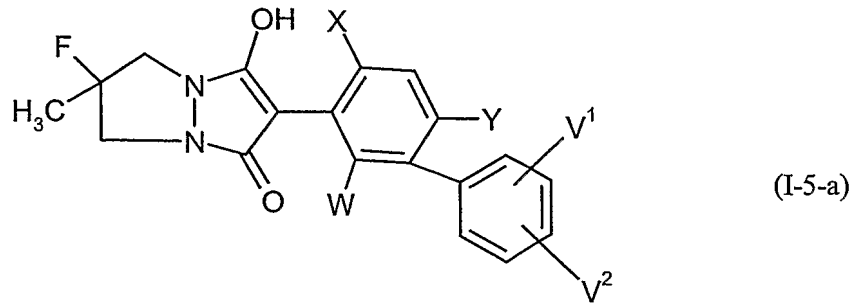
40

【0368】

実施例（I-1-a-1）と同様にして及び式（I）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（I-5-a）の化合物を得た：

【0369】

【表 1 3】



10

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	m. p. °C
I-5-a-1	H	CH ₃	H	4-F	184
I-5-a-2	H	CH ₃	H	4-Cl	33
I-5-a-3	H	Cl	H	4-F	219
I-4-a-4	H	Cl	H	4-Cl	220

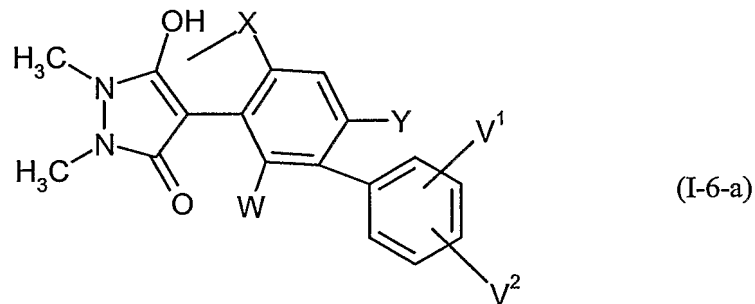
【0370】

実施例（I-1-a-1）と同様にして及び式（I）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（I-6-a）の化合物を得た：

20

【0371】

【表 1 4】



30

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	m. p. °C
I-6-a-1	H	CH ₃	H	4-F	164
I-6-a-2	H	CH ₃	H	4-Cl	130
I-6-a-3	H	Cl	H	4-Cl	156
I-6-a-4	H	Cl	H	4-F	161

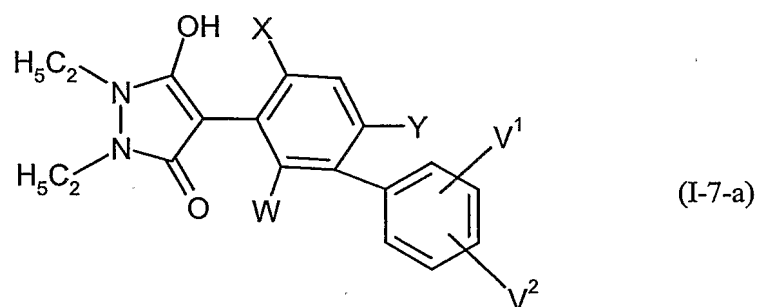
40

【0372】

実施例（I-1-a-1）と同様にして及び式（I）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（I-7-a）の化合物を得た：

【0373】

【表 1 5】



10

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	m. p. °C
I-7-a-1	H	CH ₃	H	4-F	150
I-7-a-2	H	CH ₃	H	4-Cl	160
I-7-a-3	H	Cl	H	4-F	166
I-7-a-4	H	Cl	H	4-Cl	139

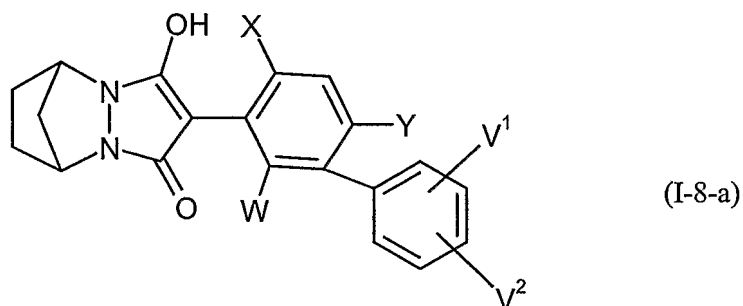
【0374】

実施例 (I-1-a-1) と同様にして及び式 (I) の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式 (I-8-a) の化合物を得た：

20

【0375】

【表 1 6】



30

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	Fp °C
I-8-a-1	H	CH ₃	H	4-Cl	210
I-8-a-2	H	Cl	H	4-Cl	130

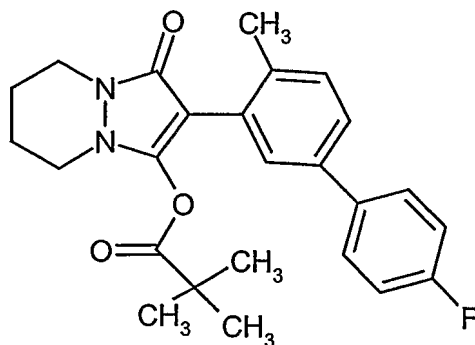
【0376】

実施例 I-1-b-1

40

【0377】

【化 1 0 0】



10

【0 3 7 8】

室温で、トリエチルアミド（0.17 g；1.63ミリモル）と、トリメチルアセチルクロリド（0.2 g；1.63ミリモル）を塩化メチレン（10 ml）に溶解した溶液とを、実施例 I-1-a-1 の化合物 0.5 g（1.48ミリモル）を塩化メチレン 20 ml に溶解した溶液に、連続的に加えた。室温で 12 時間攪拌した後に、得られた混合物を塩化メチレン 100 ml で希釈し、10%濃度のクエン酸及び 10%濃度の水酸化ナトリウム水溶液でそれぞれ 1 回洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を減圧下で除去し、残留物を石油エーテルを用いて結晶化させ、吸引濾過し、風乾した。

20

【0 3 7 9】

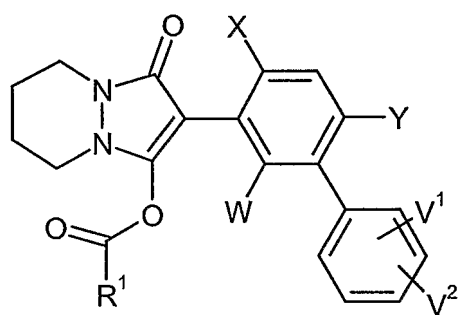
収量：0.35 g（理論値の 56%）；無色固体；m. p. 188 °C

【0 3 8 0】

実施例（I-1-b-1）と同様にして及び式（I-b）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（I-1-b）の化合物を得た：

【0 3 8 1】

【表 17】



(I-1-b)

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	R ¹	m. p. °C
I-1-b-2	H	CH ₃	H	2-Cl	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-3	H	CH ₃	H	3-Cl	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-4	H	CH ₃	H	4-Cl	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-5	H	CH ₃	H	2-F	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-6	H	CH ₃	H	3-F	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-1	H	CH ₃	H	4-F	t-C ₄ H ₉	188
I-1-b-7	H	CH ₃	H	2-CH ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-8	H	CH ₃	H	3-CH ₃	t-C ₄ H ₉	油

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	R ¹	m. p. (°C)
I-1-b-9	H	CH ₃	H	4-CH ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-10	H	CH ₃	H	2,3-Cl ₂	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-11	H	CH ₃	H	2,4-Cl ₂	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-12	H	CH ₃	H	2,5-Cl ₂	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-13	H	CH ₃	H	3,4-Cl ₂	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-14	H	CH ₃	H	3,5-Cl ₂	t-C ₄ H ₉	Öl
I-1-b-15	H	CH ₃	H	2,4-F ₂	t-C ₄ H ₉	187
I-1-b-16	H	CH ₃	H	2,5-F ₂	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-17	H	CH ₃	H	3-Cl, 4-F	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-18	H	CH ₃	H	2-CF ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-19	H	CH ₃	H	3-CF ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-20	H	CH ₃	H	4-CF ₃	t-C ₄ H ₉	175
I-1-b-21	H	CH ₃	H	2-OCH ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-22	H	CH ₃	H	3-OCH ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-23	H	CH ₃	H	4-OCH ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-24	H	CH ₃	H	3-SO ₂ C ₂ H ₅	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-25	H	CH ₃	H	4-SO ₂ C ₂ H ₅	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-26	H	CH ₃	H	3-NO ₂	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-27	H	CH ₃	H	4-OCF ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-28	H	CH ₃	H	4-OPh	t-C ₄ H ₉	油

10

20

30

40

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	R ¹	m. p. (°C)
I-1-b-29	H	CH ₃	H	4-SCH ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-30	H	CH ₃	H	4-i-C ₃ H ₇	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-31	H	CH ₃	H	3,5-(CF ₃) ₂	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-32	H	CH ₃	H	4-Cl	i-C ₃ H ₇	油
I-1-b-33	H	CH ₃	H	4-F	c-C ₃ H ₅	油
I-1-b-34	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-F	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-35	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-36	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	t-C ₄ H ₉	69
I-1-b-37	CH ₃	CH ₃	H	4-F	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-38	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	i-C ₃ H ₇	油
I-1-b-39	CH ₃	CH ₃	H	4-F	i-C ₃ H ₇	油
I-1-b-40	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	t-C ₄ H ₉	35
I-1-b-41	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	i-C ₃ H ₇	138
I-1-b-42	H	CH ₃	H	3-OCH ₃	c-C ₃ H ₅	油
I-1-b-43	H	CH ₃	H	3-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	油
I-1-b-44	H	Cl	H	4-CF ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-45	H	Cl	H	4-Cl	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-46	H	Cl	H	4-F	t-C ₄ H ₉	46
I-1-b-47	H	Cl	H	4-Cl	CH ₃	油
I-1-b-48	H	Cl	H	4-Cl	C ₂ H ₅	油

10

20

30

40

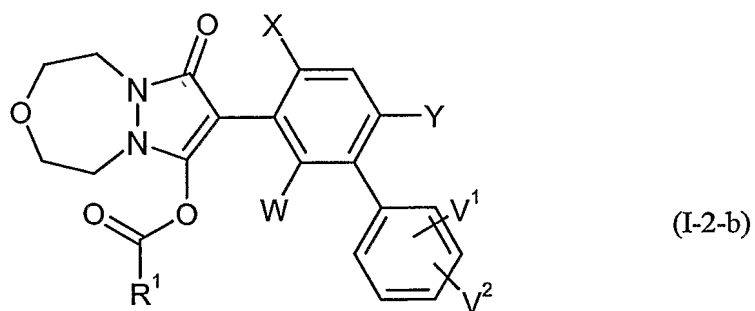
実施例番号	W	X	Y	v ¹ /v ²	R ¹	m. p. (°C)
I-1-b-49	H	Cl	H	4-Cl	i-C ₃ H ₇	油
I-1-b-50	H	Cl	H	4-Cl	c-C ₃ H ₅	油
I-1-b-51	H	Cl	H	2,4-Cl ₂	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-52	H	Cl	H	3,4-Cl ₂	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-53	H	Cl	H	3,5-Cl ₂	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-54	H	Cl	H	2,4-F ₂	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-55	H	Cl	H	3-Cl, 4-F	t-C ₄ H ₉	油
I-1-b-56	H	Cl	H	2-Cl, 5-Cl	t-C ₄ H ₉	油

【0382】

実施例（I-1-b-1）と同様にして及び式（I-b）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（I-2-b）の化合物を得た：

【0383】

【表18】



実施例番号	W	X	Y	v ¹ /v ²	R ¹	m. p. (°C)
I-2-b-1	H	CH ₃	H	2-Cl	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-2	H	CH ₃	H	3-Cl	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-3	H	CH ₃	H	4-Cl	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-4	H	CH ₃	H	2-F	t-C ₄ H ₉	油

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	R ¹	m. p. (°C)
I-2-b-5	H	CH ₃	H	3-F	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-6	H	CH ₃	H	4-F	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-7	H	CH ₃	H	2-CH ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-8	H	CH ₃	H	3-CH ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-9	H	CH ₃	H	4-CH ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-10	H	CH ₃	H	2,3-Cl ₂	t-C ₄ H ₉	155
I-2-b-11	H	CH ₃	H	2,4-Cl ₂	t-C ₄ H ₉	117
I-2-b-12	H	CH ₃	H	2,5-Cl ₂	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-13	H	CH ₃	H	3,4-Cl ₂	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-14	H	CH ₃	H	3,5-Cl ₂	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-15	H	CH ₃	H	2,4-F ₂	t-C ₄ H ₉	174
I-2-b-16	H	CH ₃	H	2,5-F ₂	t-C ₄ H ₉	184
I-2-b-17	H	CH ₃	H	3-Cl, 4-F	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-18	H	CH ₃	H	2-CF ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-19	H	CH ₃	H	3-CF ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-20	H	CH ₃	H	4-CF ₃	t-C ₄ H ₉	187
I-2-b-21	H	CH ₃	H	2-OCH ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-22	H	CH ₃	H	3-OCH ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-23	H	CH ₃	H	4-OCH ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-24	H	CH ₃	H	3-SO ₂ C ₂ H ₅	t-C ₄ H ₉	油

10

20

30

40

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	R ¹	m. p. (°C)
I-2-b-25	H	CH ₃	H	4-SO ₂ C ₂ H ₅	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-26	H	CH ₃	H	3-NO ₂	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-27	H	CH ₃	H	4-OCF ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-28	H	CH ₃	H	4-OPh	t-C ₄ H ₉	104
I-2-b-29	H	CH ₃	H	4-SCH ₃	t-C ₄ H ₉	176
I-2-b-30	H	CH ₃	H	4-i-C ₃ H ₇	t-C ₄ H ₉	138
I-2-b-31	H	CH ₃	H	4-Cl	i-C ₃ H ₇	129
I-2-b-32	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-F	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-33	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	t-C ₄ H ₉	105
I-2-b-34	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	t-C ₄ H ₉	52
I-2-b-35	CH ₃	CH ₃	H	4-F	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-36	CH ₃	CH ₃	H	4-F	i-C ₃ H ₇	油
I-2-b-37	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-38	H	CH ₃	H	2,4-Cl ₂	i-C ₃ H ₇	油
I-2-b-39	H	CH ₃	H	2,4-Cl ₂	c-C ₃ H ₅	油
I-2-b-40	H	Cl	H	4-CF ₃	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-41	H	Cl	H	4-Cl	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-42	H	Cl	H	4-F	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-43	H	Cl	H	4-Cl	CH ₃	171
I-2-b-44	H	Cl	H	4-Cl	C ₂ H ₅	183

10

20

30

40

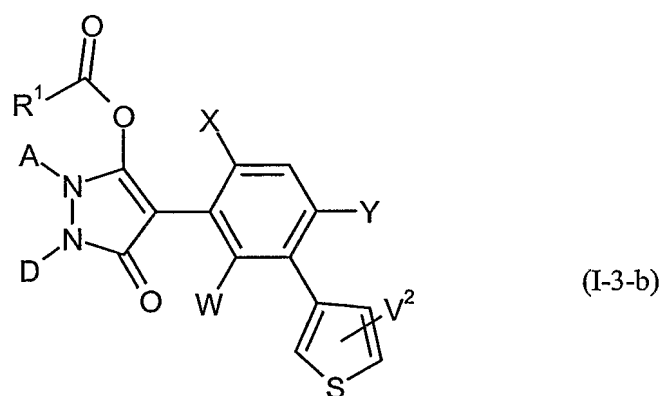
実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	R ¹	m. p. (°C)
I-2-b-45	H	Cl	H	4-Cl	i-C ₃ H ₇	189
I-2-b-46	H	Cl	H	4-Cl	c-C ₃ H ₅	172
I-2-b-47	H	Cl	H	2,4-Cl ₂	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-48	H	Cl	H	3,4-Cl ₂	t-C ₄ H ₉	103
I-2-b-49	H	Cl	H	3,5-Cl ₂	t-C ₄ H ₉	168
I-2-b-50	H	Cl	H	3-Cl, 4-F	t-C ₄ H ₉	90
I-2-b-51	H	Cl	H	2,5-Cl ₂	t-C ₄ H ₉	油
I-2-b-52	H	Cl	H	2,4-F ₂	t-C ₄ H ₉	油

【0384】

実施例（I-1-b-1）と同様にして及び式（I-b）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（I-3-b）の化合物を得た：

【0385】

【表19】



Bsp.- Nr.	W	X	Y	V ²	A	D	R ¹	m. p. °C
I-3-b-1	H	CH ₃	H	H	-(CH ₂) ₄ -		t-C ₄ H ₉	155
I-3-b-2	H	CH ₃	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		t-C ₄ H ₉	Öl

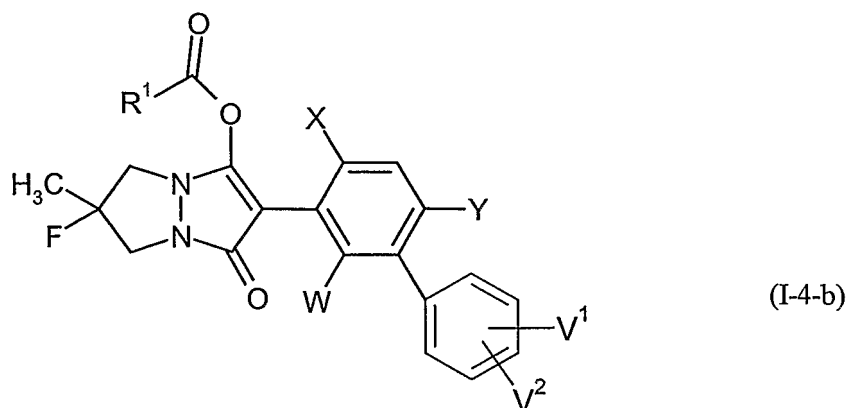
【0386】

実施例（I-1-b-1）と同様にして及び式（I-b）の化合物の製造に関する一般

的な説明に従って、次の式（I-4-b）の化合物を得た：

【0387】

【表20】



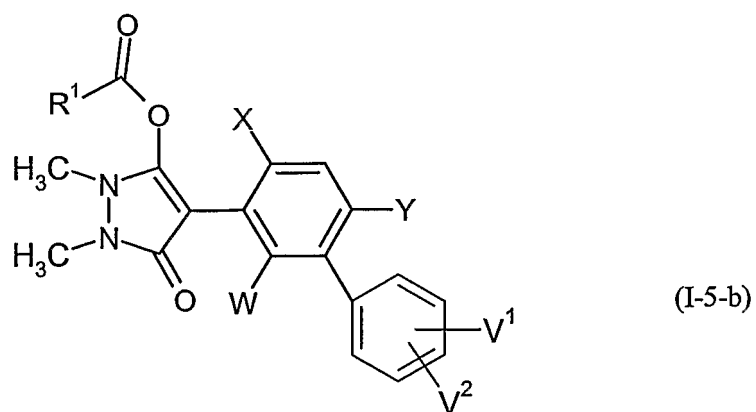
実施例番号	W	X	Y	V ² /V ²	R ¹	m. p. °C
I-4-b-1	H	CH ₃	H	4-F	t-C ₄ H ₉	158-160
I-4-b-2	H	CH ₃	Cl	4-Cl	t-C ₄ H ₉	油
I-4-b-3	H	Cl	H	4-F	t-C ₄ H ₉	油
I-4-b-4	H	Cl	H	4-Cl	t-C ₄ H ₉	油

【0388】

実施例（I-1-b-1）と同様にして及び式（I-b）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（I-5-b）の化合物を得た：

【0389】

【表21】



実施例番号	W	X	Y	V ² /V ²	R ¹	m. p. °C
I-5-b-1	H	CH ₃	H	4-F	t-C ₄ H ₉	123-124
I-5-b-2	H	CH ₃	H	4-Cl	t-C ₄ H ₉	油
I-5-b-3	H	Cl	H	4-F	t-C ₄ H ₉	43-44
I-5-b-4	H	Cl	H	4-Cl	t-C ₄ H ₉	44-45

10

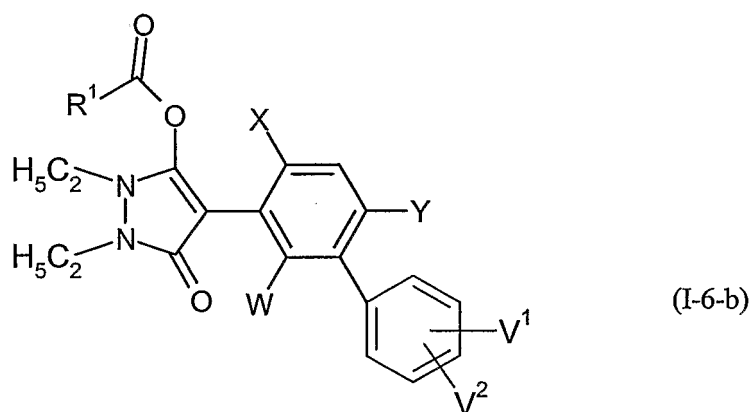
【0390】

実施例（I-1-b-1）と同様にして及び式（I-b）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（I-6-b）の化合物を得た：

【0391】

【表22】

20



30

実施例番号	W	X	Y	V ² /V ²	R ¹	m. p. °C
I-6-b-1	H	CH ₃	H	4-F	t-C ₄ H ₉	85
I-6-b-2	H	CH ₃	H	4-Cl	t-C ₄ H ₉	43
I-6-b-3	H	Cl	H	4-F	t-C ₄ H ₉	油
I-6-b-4	H	Cl	H	4-Cl	t-C ₄ H ₉	油

40

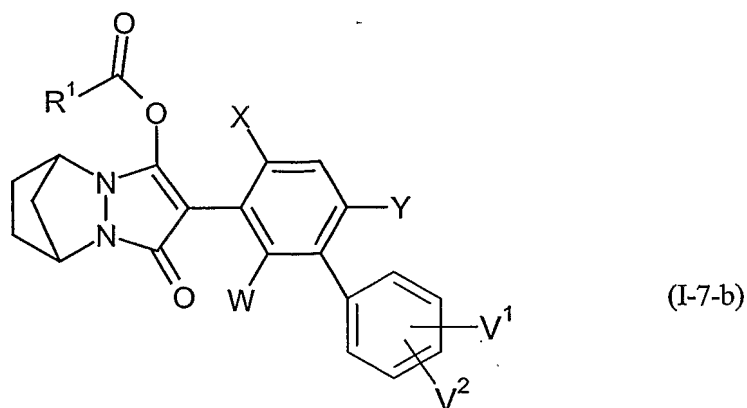
【0392】

実施例（I-1-b-1）と同様にして及び式（I-b）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（I-7-b）の化合物を得た：

【0393】

50

【表 2 3】



10

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	R ¹	m. p. °C
I-7-b-1	H	CH ₃	H	4-Cl	t-C ₄ H ₉	206
I-7-b-2	H	Cl	H	4-Cl	t-C ₄ H ₉	油

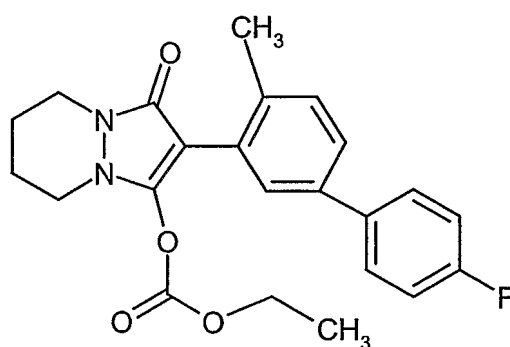
20

【0394】

実施例 I-1-c-1

【0395】

【化101】



30

【0396】

室温で、トリエチルアミン（0.13 g；1.3 μmol）と、クロロギ酸エチル（0.14 g；1.3 μmol）を塩化メチレン10 mlに溶解した溶液とを、実施例（I-a-1）の化合物0.4 g（1.2 mmol）を塩化メチレン20 mlに溶解した溶液に、連続的に加えた。室温で12時間攪拌した後に、混合物を塩化メチレン100 mlで希釈し、10%濃度のクエン酸及び10%濃度の水酸化ナトリウム水溶液でそれぞれ1回洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を減圧下で除去した。

40

【0397】

収量：0.45 g（理論値の94%）；淡褐色油状物。

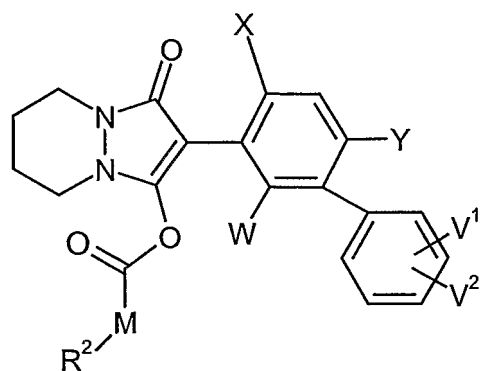
【0398】

実施例（I-1-c-1）と同様にして及び式（I-c）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（I-1-c）の化合物を得た：

【0399】

50

【表 2 4】



(I-1-c)

実施例番号	W	X	Y	V ¹ V ²	M	R ²	m. p. (°C)
I-1-c-2	H	CH ₃	H	2-Cl	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-3	H	CH ₃	H	3-Cl	O	C ₂ H ₅	172
I-1-c-4	H	CH ₃	H	4-Cl	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-5	H	CH ₃	H	2-F	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-6	H	CH ₃	H	3-F	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-1	H	CH ₃	H	4-F	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-7	H	CH ₃	H	2-CH ₃	O	C ₂ H ₅	170
I-1-c-8	H	CH ₃	H	3-CH ₃	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-9	H	CH ₃	H	4-CH ₃	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-10	H	CH ₃	H	2,3-Cl ₂	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-11	H	CH ₃	H	2,4-Cl ₂	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-12	H	CH ₃	H	2,5-Cl ₂	O	C ₂ H ₅	油

実施例番号	W	X	Y	v ¹ v ²	M	R ²	m. p. (°C)
I-1-c-13	H	CH ₃	H	3,4-Cl ₂	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-14	H	CH ₃	H	3,5-Cl ₂	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-15	H	CH ₃	H	2,4-F ₂	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-16	H	CH ₃	H	2,5-F ₂	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-17	H	CH ₃	H	3-Cl,4-F	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-18	H	CH ₃	H	3-CF ₃	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-19	H	CH ₃	H	4-CF ₃	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-20	H	CH ₃	H	2-OCH ₃	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-21	H	CH ₃	H	3-OCH ₃	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-22	H	CH ₃	H	3-SO ₂ C ₂ H ₅	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-23	H	CH ₃	H	4-SO ₂ C ₂ H ₅	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-24	H	CH ₃	H	4-OPh	O	C ₂ H ₅	81
I-1-c-25	H	CH ₃	H	4-SCH ₃	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-26	H	CH ₃	H	4-i-C ₃ H ₇	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-27	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-28	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-29	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	O	C ₂ H ₅	38
I-1-c-30	CH ₃	CH ₃	H	4-F	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-31	H	CH ₃	H	3-OCH ₃	O	H ₅ C ₂ O-(CH ₂) ₂ -	油
I-1-c-32	H	CH ₃	H	4-Cl	O	C ₂ H ₅	油

10

20

30

40

実施例番号	W	X	Y	V ¹ V ²	M	R ²	m. p. (°C)
I-1-c-33	H	Cl	H	4-F	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-34	H	Cl	H	4-Cl	O	CH ₃	油
I-1-c-35	H	Cl	H	4-Cl	O	H ₅ C ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	油
I-1-c-36	H	Cl	H	3,4-Cl ₂	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-37	H	Cl	H	3,5-Cl ₂	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-38	H	Cl	H	2,4-F ₂	O	C ₂ H ₅	油
I-1-c-39	H	Cl	H	2,5-Cl ₂	O	C ₂ H ₅	201

10

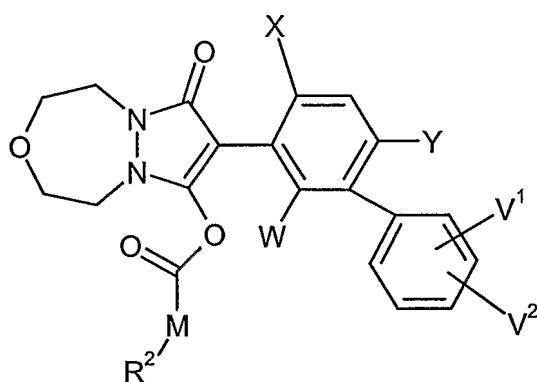
【0400】

20

実施例（I-1-c-1）と同様にして及び式（I-c）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（I-2-c）の化合物を得た：

【0401】

【表25】



(I-2-c)

30

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	M	R ²	m. p. (°C)
I-2-c-1	H	CH ₃	H	2-Cl	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-2	H	CH ₃	H	3-Cl	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-3	H	CH ₃	H	4-Cl	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-4	H	CH ₃	H	2-F	O	C ₂ H ₅	油

40

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	M	R ²	m. p. (°C)
I-2-c-5	H	CH ₃	H	3-F	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-6	H	CH ₃	H	4-F	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-7	H	CH ₃	H	2-CH ₃	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-8	H	CH ₃	H	3-CH ₃	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-9	H	CH ₃	H	4-CH ₃	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-10	H	CH ₃	H	2,3-Cl ₂	O	C ₂ H ₅	178
I-2-c-11	H	CH ₃	H	2,4-Cl ₂	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-12	H	CH ₃	H	2,5-Cl ₂	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-13	H	CH ₃	H	3,4-Cl ₂	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-14	H	CH ₃	H	3,5-Cl ₂	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-15	H	CH ₃	H	2,4-F ₂	O	C ₂ H ₅	120
I-2-c-16	H	CH ₃	H	2,5-F ₂	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-17	H	CH ₃	H	3-Cl,4-F	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-18	H	CH ₃	H	2-CF ₃	O	C ₂ H ₅	172
I-2-c-19	H	CH ₃	H	3-CF ₃	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-20	H	CH ₃	H	4-CF ₃	O	C ₂ H ₅	111
I-2-c-21	H	CH ₃	H	2-OCH ₃	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-22	H	CH ₃	H	3-OCH ₃	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-23	H	CH ₃	H	4-OCH ₃	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-24	H	CH ₃	H	3-SO ₂ C ₂ H ₅	O	C ₂ H ₅	油

10

20

30

40

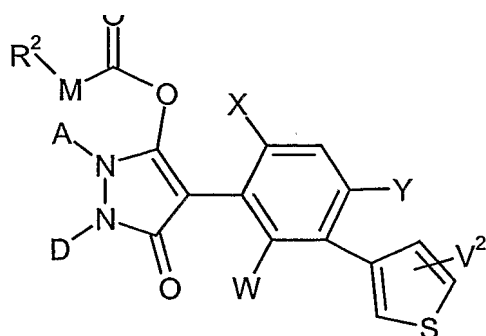
実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	M	R ²	m. p. (°C)
I-2-c-25	H	CH ₃	H	4-SO ₂ C ₂ H ₅	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-26	H	CH ₃	H	3-NO ₂	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-27	H	CH ₃	H	4-OCF ₃	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-28	H	CH ₃	H	4-OPh	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-29	H	CH ₃	H	4-SCH ₃	O	C ₂ H ₅	131
I-2-c-30	H	CH ₃	H	4-i-C ₃ H ₇	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-31	H	CH ₃	H	3,5-(CF ₃) ₂	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-32	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	O	C ₂ H ₅	53
I-2-c-33	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-34	CH ₃	CH ₃	H	4-F	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-35	H	CH ₃	H	2,4-Cl ₂	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-36	H	Cl	H	4-F	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-37	H	Cl	H	4-Cl	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-38	H	Cl	H	4-Cl	O	CH ₃	198
I-2-c-39	H	Cl	H	4-Cl	O	H ₅ C ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	油
I-2-c-40	H	Cl	H	3,5-Cl ₂	O	C ₂ H ₅	150
I-2-c-41	H	Cl	H	2,4-F ₂	O	C ₂ H ₅	油
I-2-c-42	H	Cl	H	2,5-Cl ₂	O	C ₂ H ₅	50

【 0 4 0 2 】

実施例（I-1-c-1）と同様にして及び式（I-c）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（I-3-c）の化合物を得た：

【 0 4 0 3 】

【表 2 6】



10

実施例番号	W	X	Y	V ²	A	D	M	R ²	
I-3-c-1	H	CH ₃	H	H	-(CH ₂) ₄ -		O	C ₂ H ₅	油
I-3-c-2	H	CH ₃	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	油

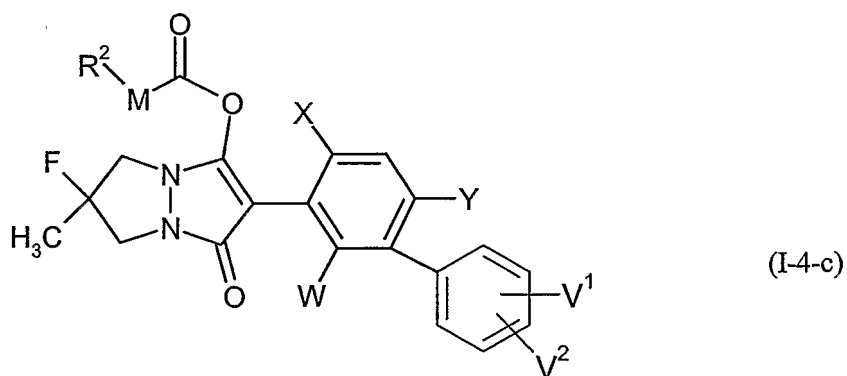
【0 4 0 4】

20

実施例 (I-1-c-1) と同様にして及び式 (I-c) の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式 (I-4-c) の化合物を得た：

【0 4 0 5】

【表 2 7】



30

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	M	R ²	m. p. °C
I-4-c-1	H	CH ₃	H	4-F	O	C ₂ H ₅	油
I-4-c-2	H	Cl	H	4-Cl	O	C ₂ H ₅	油

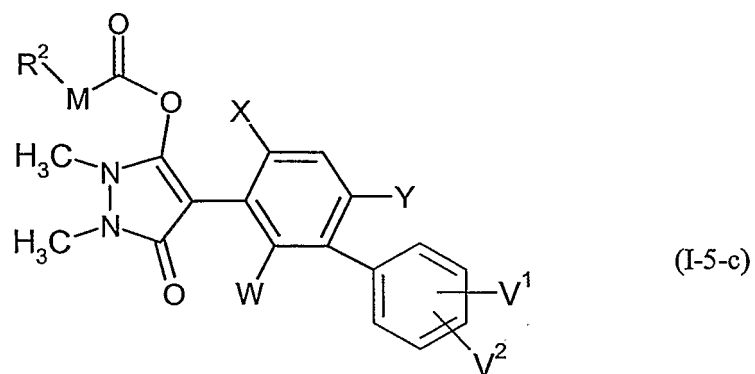
40

【0 4 0 6】

実施例 (I-1-c-1) と同様にして及び式 (I-c) の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式 (I-5-c) の化合物を得た：

【0 4 0 7】

【表 28】



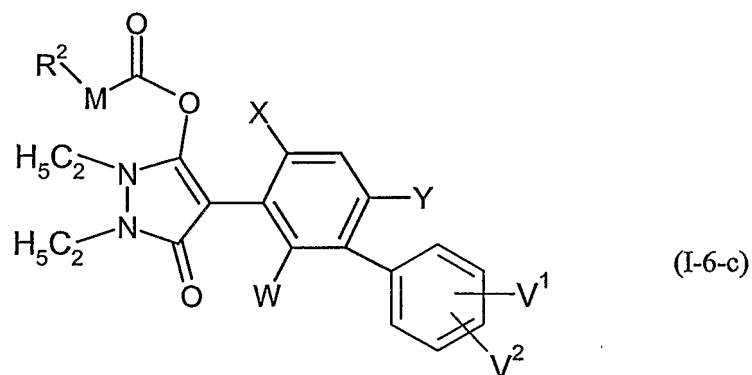
実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	M	R ²	m. p. °C
I-5-c-1	H	CH ₃	H	4-F	O	C ₂ H ₅	油
I-5-c-2	H	CH ₃	H	4-Cl	O	C ₂ H ₅	油
I-5-c-3	H	Cl	H	4-F	O	C ₂ H ₅	油
I-5-c-4	H	Cl	H	4-Cl	O	C ₂ H ₅	油

【0408】

実施例（I-1-c-1）と同様にして及び式（I-c）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（I-6-c）の化合物を得た：

【0409】

【表 29】



実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	M	R ²	m. p. °C
I-6-c-1	H	Cl	H	4-Cl	O	C ₂ H ₅	油

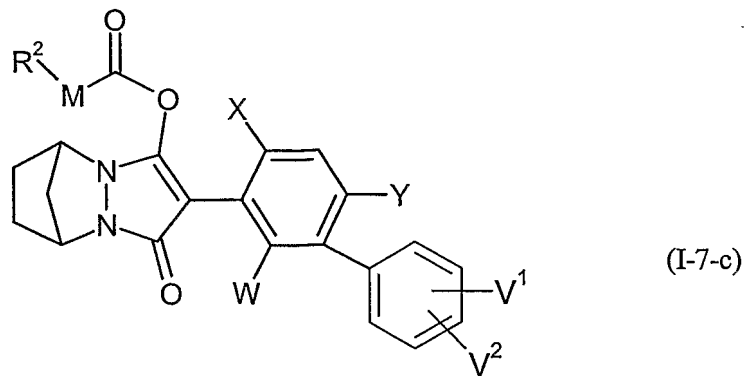
【0410】

実施例（I-1-c-1）と同様にして及び式（I-c）の化合物の製造に関する一般

的な説明に従って、次の式（I-7-c）の化合物を得た：

【0411】

【表30】



10

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	M	R ²	m. p. °C
I-7-c-1	H	CH ₃	H	4-Cl	O	C ₂ H ₅	25
I-7-c-1	H	Cl	H	4-Cl	O	C ₂ H ₅	26

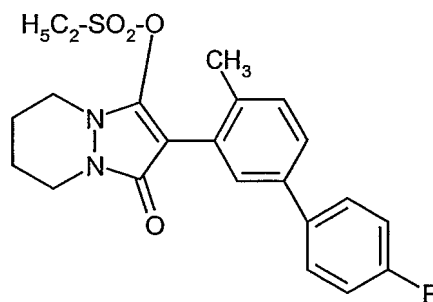
20

【0412】

実施例 I-d-1

【0413】

【表102】



30

【0414】

室温で、トリエチルアミン（0.13 g；1.3ミリモル）と、エチルスルホニルクロリド（0.17 g；1.3ミリモル）をジクロロメタン10 mlに溶解した溶液とを、実施例（I-1-a-1）の化合物0.4 g（1.2ミリモル）をジクロロメタン20 mlに溶解した溶液に、連続的に加えた。室温で10時間攪拌した後に、得られた混合物をジクロロメタン100 mlで希釈し、10%濃度のクエン酸及び10%濃度の水酸化ナトリウム水溶液でそれぞれ1回洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を減圧下で除去した。

40

【0415】

収量：0.4 g（理論値の70%）；淡褐色油状物。

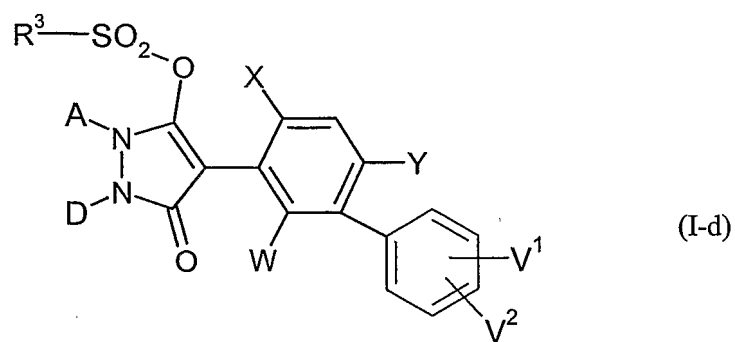
【0416】

実施例（I-d-1）と同様にして及び製造に関する一般的な説明に従って、次の式（I-d）の化合物を得た：

【0417】

50

【表 3 1】



10

実施例番号	W	X	Y	v1/v2	A	D	R ³	m. p. °C
I-d-2	H	Cl	H	4-Cl	-(CH ₂) ₄ -		C ₂ H ₅	油
I-d-3	H	Cl	H	4-Cl	-(CH ₂) ₄ -		i-C ₃ H ₇	油
I-d-4	H	Cl	H	4-Cl	-(CH ₂) ₄ -		CH ₃	油
I-d-5	H	Cl	H	4-Cl	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂		C ₂ H ₅	163
I-d-6	H	Cl	H	4-Cl	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂		i-C ₃ H ₇	油
I-d-7	H	Cl	H	4-Cl	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂		CH ₃	201

20

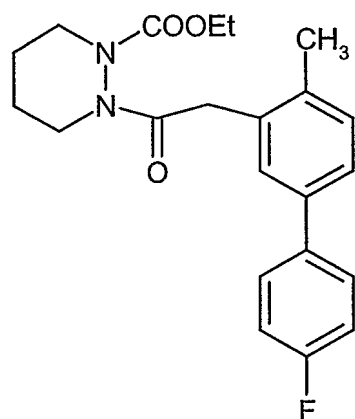
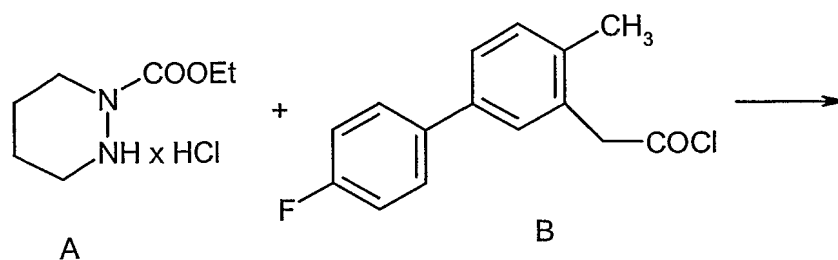
【 0 4 1 8 】

実施例 V - 1 - 1

【 0 4 1 9 】

30

【化 1 0 3】



(V-1-1)

【0 4 2 0】

化合物 A 1.04 g (5.3 ミリモル) を塩化メチレン 30 ml に溶解し、トリエチルアミン 1.2 g (11.8 μ モル) と、化合物 B 1.4 g (5.3 ミリモル) を塩化メチレン 20 ml に溶解した溶液とを連続的に滴加した。混合物を室温で 12 時間攪拌し、塩化メチレン 100 ml を加え、得られた混合物を 2 N 塩酸及び水でそれぞれ 1 回洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮した。

【0 4 2 1】

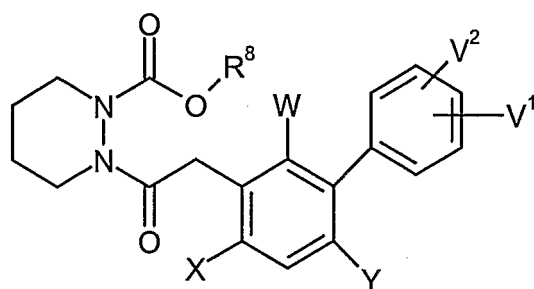
収量：2 g (理論値の 98%) ; 黄色油状物 (これはこの後の反応のためにさらに精製されていない)。

【0 4 2 2】

実施例 (V-1-1) と同様にして及び式 (V) の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式 (V-1) の化合物を得た：

【0 4 2 3】

【表 3 2】



(V-1)

10

20

30

40

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	R ⁸	m. p. (°C)
V-1-2	H	CH ₃	H	2-Cl	C ₂ H ₅	油
V-1-3	H	CH ₃	H	3-Cl	C ₂ H ₅	油
V-1-4	H	CH ₃	H	4-Cl	C ₂ H ₅	油
V-1-5	H	CH ₃	H	2-F	C ₂ H ₅	油
V-1-6	H	CH ₃	H	3-F	C ₂ H ₅	油
V-1-1	H	CH ₃	H	4-F	C ₂ H ₅	油
V-1-7	H	CH ₃	H	2-CH ₃	C ₂ H ₅	油
V-1-8	H	CH ₃	H	3-CH ₃	C ₂ H ₅	油
V-1-9	H	CH ₃	H	4-CH ₃	C ₂ H ₅	油
V-1-10	H	CH ₃	H	2,3-Cl ₂	C ₂ H ₅	油
V-1-11	H	CH ₃	H	2,4-Cl ₂	C ₂ H ₅	油
V-1-12	H	CH ₃	H	2,5-Cl ₂	C ₂ H ₅	油
V-1-13	H	CH ₃	H	3,4-Cl ₂	C ₂ H ₅	油
V-1-14	H	CH ₃	H	3,5-Cl ₂	C ₂ H ₅	油
V-1-15	H	CH ₃	H	2,4-F ₂	C ₂ H ₅	油
V-1-16	H	CH ₃	H	2,5-F ₂	C ₂ H ₅	油
V-1-17	H	CH ₃	H	3-Cl,4-F	C ₂ H ₅	油
V-1-18	H	CH ₃	H	2-CF ₃	C ₂ H ₅	油
V-1-19	H	CH ₃	H	3-CF ₃	C ₂ H ₅	油
V-1-20	H	CH ₃	H	4-CF ₃	C ₂ H ₅	油

10

20

30

40

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	R ⁸	m. p. (°C)
V-1-21	H	CH ₃	H	2-OCH ₃	C ₂ H ₅	油
V-1-22	H	CH ₃	H	3-OCH ₃	C ₂ H ₅	油
V-1-23	H	CH ₃	H	4-OCH ₃	C ₂ H ₅	油
V-1-24	H	CH ₃	H	3-SO ₂ C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	油
V-1-25	H	CH ₃	H	4-SO ₂ C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	油
V-1-26	H	CH ₃	H	3-NO ₂	C ₂ H ₅	油
V-1-27	H	CH ₃	H	4-OCF ₃	C ₂ H ₅	油
V-1-28	H	CH ₃	H	4-OPh	C ₂ H ₅	油
V-1-29	H	CH ₃	H	4-SCH ₃	C ₂ H ₅	油
V-1-30	H	CH ₃	H	4-i-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	油
V-1-31	H	CH ₃	H	3,5-(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	油
V-1-32	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-F	C ₂ H ₅	油
V-1-33	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	C ₂ H ₅	油
V-1-34	CH ₃	CH ₃	H	4-F	C ₂ H ₅	油
V-1-35	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	C ₂ H ₅	油
V-1-36	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	C ₂ H ₅	油
V-1-37	H	Cl	H	4-F	C ₂ H ₅	油
V-1-38	H	Cl	H	4-Cl	C ₂ H ₅	油
V-1-39	H	Cl	H	4-CF ₃	C ₂ H ₅	油
V-1-40	H	Cl	H	2,4-Cl ₂	C ₂ H ₅	油

10

20

30

40

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	R ⁸	m. p. (°C)
V-1-41	H	Cl	H	3,4-Cl ₂	C ₂ H ₅	65
V-1-42	H	Cl	H	3,5-Cl ₂	C ₂ H ₅	Öl
V-1-43	H	Cl	H	2,4-F ₂	C ₂ H ₅	Öl
V-1-44	H	Cl	H	3-Cl, 4-F	C ₂ H ₅	Öl
V-1-45	H	Cl	H	2,5-Cl ₂	C ₂ H ₅	Öl

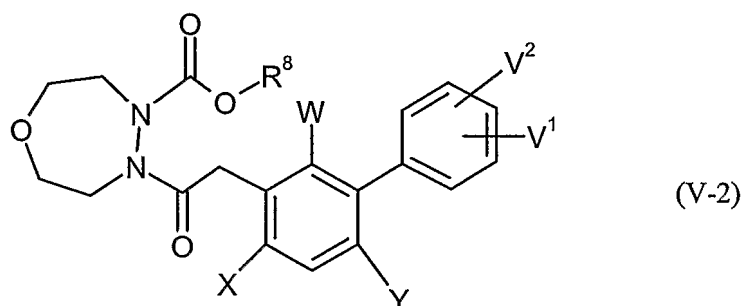
10

【0424】

実施例（V-1-1）と同様にして及び式（V）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（V-2）の化合物を得た：

【0425】

【表33】



20

30

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	R ⁸	m. p. (°C)
V-2-1	H	CH ₃	H	2-Cl	C ₂ H ₅	油
V-2-2	H	CH ₃	H	3-Cl	C ₂ H ₅	油
V-2-3	H	CH ₃	H	4-Cl	C ₂ H ₅	油
V-2-4	H	CH ₃	H	2-F	C ₂ H ₅	油
V-2-5	H	CH ₃	H	3-F	C ₂ H ₅	油
V-2-6	H	CH ₃	H	4-F	C ₂ H ₅	油
V-2-7	H	CH ₃	H	2-CH ₃	C ₂ H ₅	油

40

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	R ⁸	m. p. (°C)
V-2-8	H	CH ₃	H	3-CH ₃	C ₂ H ₅	油
V-2-9	H	CH ₃	H	4-CH ₃	C ₂ H ₅	油
V-2-10	H	CH ₃	H	2,3-Cl ₂	C ₂ H ₅	油
V-2-11	H	CH ₃	H	2,4-Cl ₂	C ₂ H ₅	油
V-2-12	H	CH ₃	H	2,5-Cl ₂	C ₂ H ₅	油
V-2-13	H	CH ₃	H	3,4-Cl ₂	C ₂ H ₅	油
V-2-14	H	CH ₃	H	3,5-Cl ₂	C ₂ H ₅	油
V-2-15	H	CH ₃	H	2,4-F ₂	C ₂ H ₅	油
V-2-16	H	CH ₃	H	2,5-F ₂	C ₂ H ₅	油
V-2-17	H	CH ₃	H	3-Cl, 4-F	C ₂ H ₅	油
V-2-18	H	CH ₃	H	2-CF ₃	C ₂ H ₅	油
V-2-19	H	CH ₃	H	3-CF ₃	C ₂ H ₅	油
V-2-20	H	CH ₃	H	4-CF ₃	C ₂ H ₅	油
V-2-21	H	CH ₃	H	2-OCH ₃	C ₂ H ₅	油
V-2-22	H	CH ₃	H	3-OCH ₃	C ₂ H ₅	油
V-2-23	H	CH ₃	H	4-OCH ₃	C ₂ H ₅	油
V-2-24	H	CH ₃	H	3-SO ₂ C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	油
V-2-25	H	CH ₃	H	4-SO ₂ C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	油
V-2-26	H	CH ₃	H	3-NO ₂	C ₂ H ₅	油
V-2-27	H	CH ₃	H	4-OCF ₃	C ₂ H ₅	油

10

20

30

40

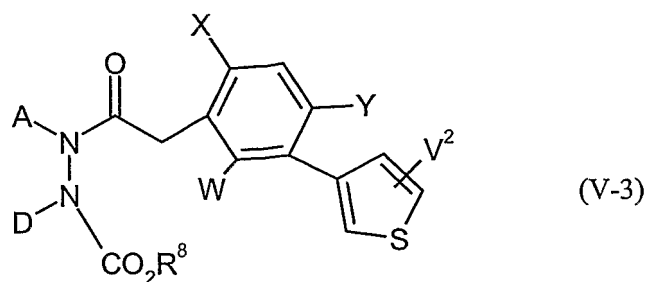
実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	R ⁸	m. p. (°C)
V-2-28	H	CH ₃	H	4-OPh	C ₂ H ₅	油
V-2-29	H	CH ₃	H	4-SCH ₃	C ₂ H ₅	油
V-2-30	H	CH ₃	H	4-i-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	油
V-2-31	H	CH ₃	H	3,5-(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	油
V-2-32	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-F	C ₂ H ₅	油
V-2-33	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	C ₂ H ₅	油
V-2-34	CH ₃	CH ₃	H	4-F	C ₂ H ₅	油
V-2-35	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	C ₂ H ₅	油
V-2-36	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	C ₂ H ₅	油
V-2-37	H	Cl	H	4-F	C ₂ H ₅	油
V-2-38	H	Cl	H	4-Cl	C ₂ H ₅	油
V-2-39	H	Cl	H	4-CF ₃	C ₂ H ₅	油
V-2-40	H	Cl	H	2,4-Cl ₂	C ₂ H ₅	油
V-2-41	H	Cl	H	3,4-Cl ₂	C ₂ H ₅	油
V-2-42	H	Cl	H	3,5-Cl ₂	C ₂ H ₅	油
V-2-43	H	Cl	H	2,4-F ₂	C ₂ H ₅	油
V-2-44	H	Cl	H	3-Cl, 4-F	C ₂ H ₅	油
V-2-45	H	Cl	H	2,5-Cl ₂	C ₂ H ₅	油

【0426】

実施例（V-1-1）と同様にして及び式（V）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（V-3）の化合物を得た：

【0427】

【表 3 4】



10

実施例番号	W	X	Y	V ²	A	D	R	
V-3-1	H	CH ₃	H	H	-(CH ₂) ₄ -		C ₂ H ₅	油
V-3-2	H	CH ₃	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂		C ₂ H ₅	油

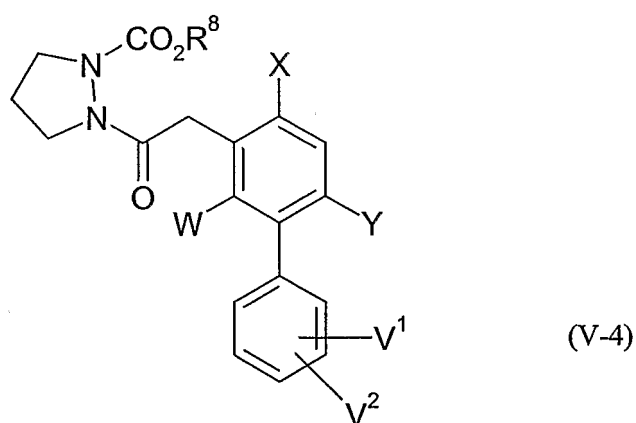
【0 4 2 8】

20

実施例（V-1-1）と同様にして及び式（V）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（V-4）の化合物を得た：

【0 4 2 9】

【表 3 5】



30

実施例番号	W	X	Y	V ¹ / V ²	R ⁸	m. p. °C
V-4-1	H	CH ₃	H	4-F	C ₂ H ₅	油

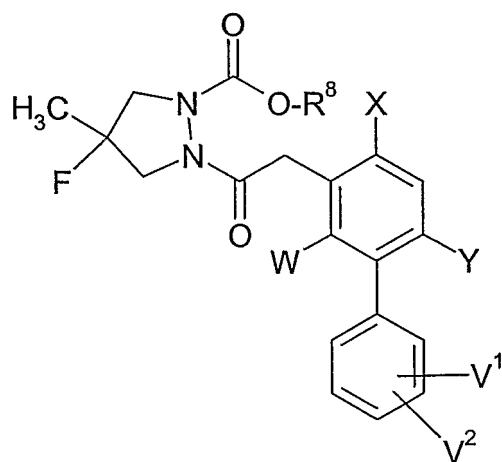
40

【0 4 3 0】

実施例（V-1-1）と同様にして及び式（V）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（V-5）の化合物を得た：

【0 4 3 1】

【表 3 6】



(V-5)

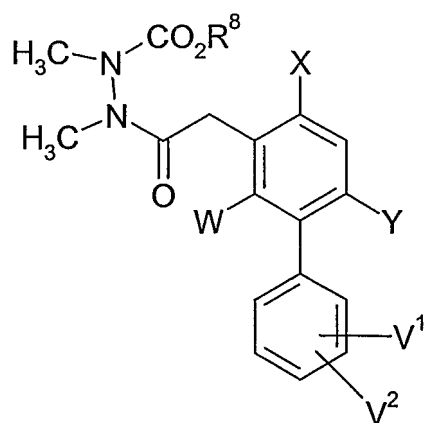
実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	R ⁸	m. p. °C
V-5-1	H	CH ₃	H	4-F	C ₂ H ₅	油
V-5-2	H	CH ₃	H	4-Cl	C ₂ H ₅	油
V-5-3	H	Cl	H	4-F	C ₂ H ₅	油
V-5-4	H	Cl	H	4-Cl	C ₂ H ₅	油

【0 4 3 2】

実施例（V-1-1）と同様にして及び式（V）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（V-6）の化合物を得た：

【0 4 3 3】

【表 3 7】



(V-6)

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	R ⁸	m. p. °C
V-6-1	H	CH ₃	H	4-F	C ₂ H ₅	油

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	R ⁸	m. p. °C
V-6-2	H	CH ₃	H	4-Cl	C ₂ H ₅	油
V-6-3	H	Cl	H	4-F	C ₂ H ₅	油
V-6-4	H	Cl	H	4-Cl	C ₂ H ₅	油

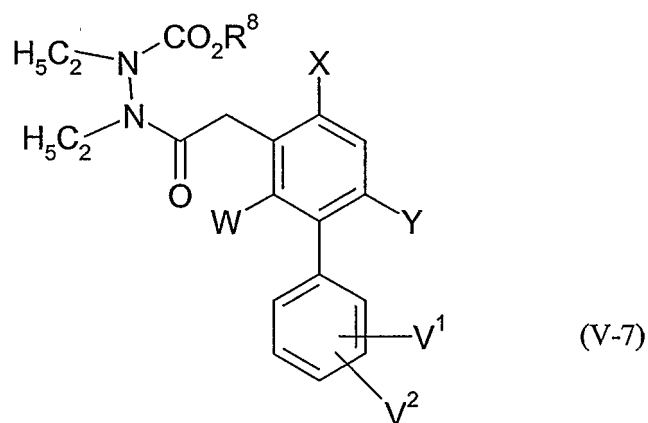
10

【0434】

実施例（V-1-1）と同様にして及び式（V）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（V-7）の化合物を得た：

【0435】

【表38】



20

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	R ⁸	m. p. °C
V-7-1	H	CH ₃	H	4-F	C ₂ H ₅	油
V-7-2	H	CH ₃	H	4-Cl	C ₂ H ₅	油
V-7-3	H	Cl	H	4-F	C ₂ H ₅	油
V-7-4	H	Cl	H	4-Cl	C ₂ H ₅	油

30

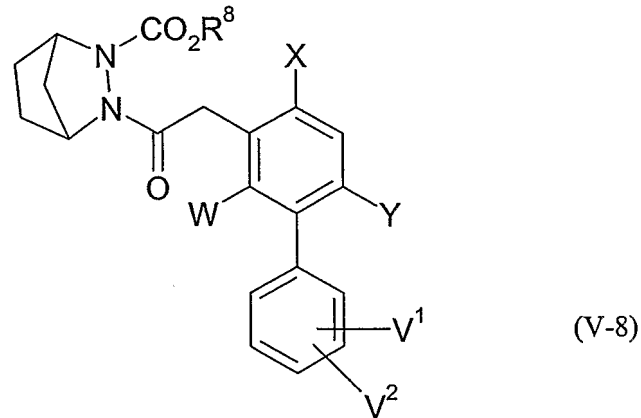
【0436】

実施例（V-1-1）と同様にして及び式（V）の化合物の製造に関する一般的な説明に従って、次の式（V-8）の化合物を得た：

【0437】

40

【表 3 9】



10

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	R ⁸	m. p. °C
V-8-1	H	CH ₃	H	4-Cl	C ₂ H ₅	33
V-8-2	H	Cl	H	4-Cl	C ₂ H ₅	28

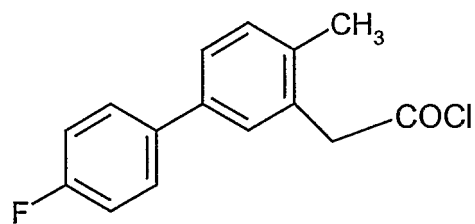
20

【0438】

実施例 (X I X - 1)

【0439】

【化104】



30

【0440】

実施例 (X X - 1) の化合物 1. 6 g (6. 6 ミリモル) を塩化メチレン 30 m l に溶解し、室温で、塩化オキサリル 1. 24 g (9. 0 ミリモル) を塩化メチレン 10 m l に溶解した溶液を滴加した。混合物を室温で 12 時間攪拌し、次いで反応を完結させるために、還流下で 3 時間加熱した。得られた溶液を減圧下で濃縮した。残留物をさらに精製することなく次の反応工程に使用した。

40

【0441】

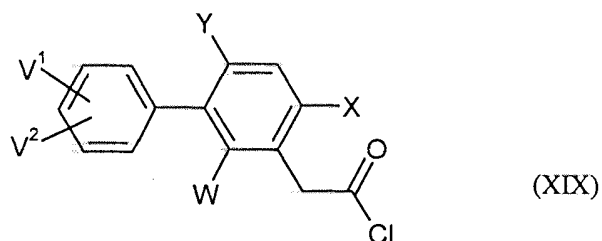
収量：1. 6 g (理論値の 92%) ; 黄色油状物。

【0442】

次の式 (X I X) (式中、T = C l である) の化合物を実施例 (X I X - 1) と同様にして得た：

【0443】

【表 4 0】



すべて油として単離される

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	δ -CH ₂ COCl (ppm) in CDCl ₃
XIX-2	H	CH ₃	H	2-Cl	4.21 (s)
XIX-3	H	CH ₃	H	3-Cl	4.22 (s)
XIX-4	H	CH ₃	H	2-F	4.22 (s)
XIX-5	H	CH ₃	H	3-F	4.22 (s)
XIX-1	H	CH ₃	H	4-F	4.22 (s)
XIX-6	H	CH ₃	H	2-CH ₃	4.18 (s)
XIX-7	H	CH ₃	H	3-CH ₃	4.21 (s)
XIX-8	H	CH ₃	H	4-CH ₃	4.21 (s)
XIX-9	H	CH ₃	H	2,3-Cl ₂	4.20 (s)
XIX-10	H	CH ₃	H	2,4-Cl ₂	4.21 (s)
XIX-11	H	CH ₃	H	2,5-Cl ₂	4.21 (s)
XIX-12	H	CH ₃	H	3,4-Cl ₂	4.23 (s)
XIX-13	H	CH ₃	H	3,5-Cl ₂	4.22 (s)
XIX-14	H	CH ₃	H	2,4-F ₂	4.21 (s)
XIX-15	H	CH ₃	H	2,5-F ₂	4.21 (s)
XIX-16	H	CH ₃	H	3-Cl,4-F	4.22 (s)
XIX-17	H	CH ₃	H	2-CF ₃	4.18 (s)
XIX-18	H	CH ₃	H	3-CF ₃	4.24 (s)
XIX-19	H	CH ₃	H	4-CF ₃	4.24 (s)
XIX-20	H	CH ₃	H	2-OCH ₃	4.18 (s)
XIX-21	H	CH ₃	H	3-OCH ₃	4.21 (s)
XIX-22	H	CH ₃	H	4-OCH ₃	4.20 (s)
XIX-23	H	CH ₃	H	3-SO ₂ C ₂ H ₅	4.25 (s)
XIX-24	H	CH ₃	H	4-SO ₂ C ₂ H ₅	4.25 (s)
XIX-25	H	CH ₃	H	3-NO ₂	4.26 (s)
XIX-26	H	CH ₃	H	4-OCF ₃	4.16 (s)

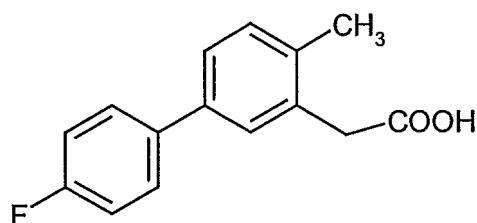
実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	δ-CH ₂ COCl (ppm) in CDCl ₃
XIX-27	H	CH ₃	H	4-OPh	4.22 (s)
XIX-28	H	CH ₃	H	4-SCH ₃	4.21 (s)
XIX-29	H	CH ₃	H	4-i-C ₃ H ₇	4.21 (s)
XIX-30	H	CH ₃	H	3,5-(CF ₃) ₂	4.27 (s)
XIX-31	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-F	4.26 (s)
XIX-32	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	4.14 (s)
XIX-33	CH ₃	CH ₃	H	4-F	4.31 (s)
XIX-34	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	4.31 (s)
XIX-35	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	4.26 (s)
XIX-36	H	Cl	H	4-F	4.35 (s)
XIX-37	H	Cl	H	4-Cl	4.34 (s)
XIX-38	H	Cl	H	4-CF ₃	4.37 (s)
XIX-39	H	Cl	H	2,4-Cl ₂	4.34 (s)
XIX-40	H	Cl	H	3,4-Cl ₂	4.36 (s)
XIX-41	H	Cl	H	3,5-Cl ₂	4.36 (s)
XIX-42	H	Cl	H	2,4-F ₂	4.35 (s)
XIX-43	H	Cl	H	3-Cl, 4-F	4.36 (s)
XIX-44	H	Cl	H	2,5-Cl ₂	4.35 (s)

【0444】

実施例 (XX-1)

【0445】

【化105】



【0446】

実施例 (XXI-6) の化合物 2 g (7.75 ミリモル) をメタノール 20 ml に溶解し、室温で、NaOH 0.46 g (11.6 ミリモル) を水 20 ml に溶解した溶液を加えた。得られた混合物を室温で 12 時間攪拌し、メタノールを減圧下で除去し、残留物を水 100 ml に溶解した。得られたアルカリ性溶液を塩化メチレンで 3 回抽出し、次いで 2 N 塩酸で酸性化した。得られた酸性溶液を塩化メチレンで 3 回抽出し、有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮した。残留物を石油エーテルと共に磨砕し、吸引濾過した。

【0447】

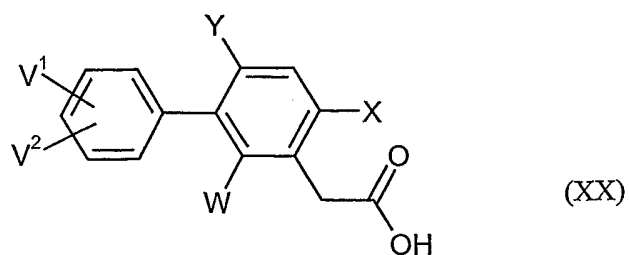
収量：1.8 g (理論値の 95%) ; 無色固体 ; m. p. 107 °C.

【0448】

次の式 (XX) の化合物を、実施例 (XX-1) と同様にして得た。

【0449】

【表41】



実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	m. p. (°C)
XX-2	H	CH ₃	H	2-Cl	123
XX-3	H	CH ₃	H	3-Cl	136
XX-4	H	CH ₃	H	2-F	92
XX-5	H	CH ₃	H	3-F	114
XX-1	H	CH ₃	H	4-F	107
XX-6	H	CH ₃	H	2-CH ₃	93
XX-7	H	CH ₃	H	3-CH ₃	105
XX-8	H	CH ₃	H	4-CH ₃	123
XX-9	H	CH ₃	H	2,3-Cl ₂	158
XX-10	H	CH ₃	H	2,4-Cl ₂	104
XX-11	H	CH ₃	H	2,5-Cl ₂	147
XX-12	H	CH ₃	H	3,4-Cl ₂	142
XX-13	H	CH ₃	H	3,5-Cl ₂	175
XX-14	H	CH ₃	H	2,4-F ₂	113
XX-15	H	CH ₃	H	2,5-F ₂	133
XX-16	H	CH ₃	H	3-Cl,4-F	191

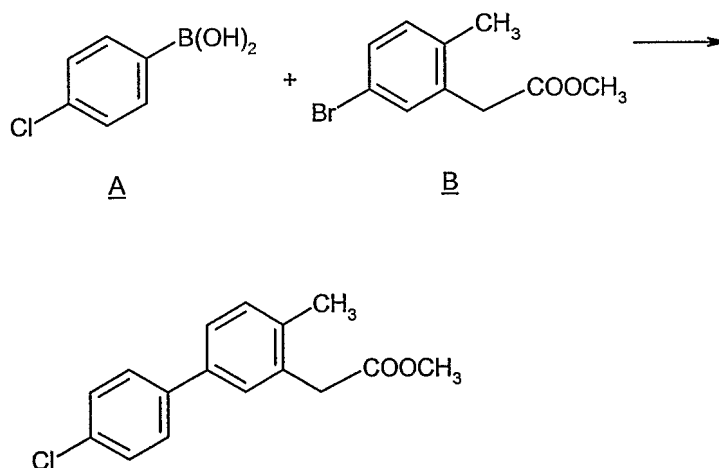
実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	m. p. (°C)
XX-37	H	Cl	H	4-CF ₃	154
XX-38	H	Cl	H	2,4-Cl ₂	110
XX-39	H	Cl	H	3,4-Cl ₂	182
XX-40	H	Cl	H	3,5-Cl ₂	154
XX-41	H	Cl	H	2,4-F ₂	145
XX-42	H	Cl	H	3-Cl, 4-F	228
XX-43	H	Cl	H	2,5-Cl ₂	171
XX-44	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	165

【 0 4 5 0 】

实施例 (X X I - 1)

【 0 4 5 1 】

【化 1 0 6】



【 0 4 5 2 】

化合物B 14.8 g (61ミリモル)を最初にジメトキシエタン70mlに加え、室温で、炭酸ナトリウムの1モル溶液56ml、化合物A (12.4g; 80ミリモル)及び触媒量のビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)クロリドをアルゴン雰囲気下で連続的に加えた。混合物を80℃で12時間加熱し、次いで室温まで冷却し、水150mlを加え、得られた混合物を酢酸エチルで3回抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。

【 0 4 5 3 】

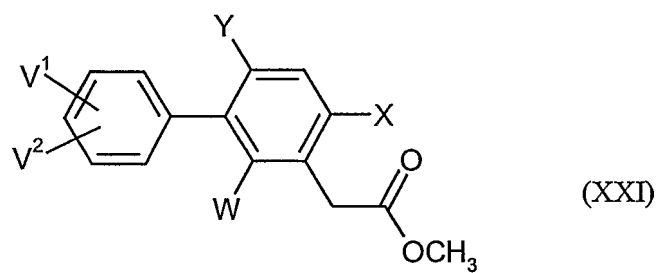
収量：16.7 g（定量的）；黄色褐色油状物（これはさらに精製することなく別の合成に使用した）。

【 0 4 5 4 】

$R^8 = CH_3$ である次の式 (XXI) の化合物を、実施例 (XX-1) と同様にして得た。

【0455】

【表42】



実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	m. p. (°C)
XXI-2	H	CH ₃	H	2-Cl	油
XXI-3	H	CH ₃	H	3-Cl	油
XXI-4	H	CH ₃	H	2-F	油
XXI-5	H	CH ₃	H	3-F	油
XXI-6	H	CH ₃	H	4-F	油
XXI-7	H	CH ₃	H	2-CH ₃	油
XXI-8	H	CH ₃	H	3-CH ₃	油
XXI-9	H	CH ₃	H	4-CH ₃	油
XXI-10	H	CH ₃	H	2,3-Cl ₂	油
XXI-11	H	CH ₃	H	2,4-Cl ₂	油
XXI-12	H	CH ₃	H	2,5-Cl ₂	油
XXI-13	H	CH ₃	H	3,4-Cl ₂	油
XXI-14	H	CH ₃	H	3,5-Cl ₂	油

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	m. p. (°C)
XXI-15	H	CH ₃	H	2,4-F ₂	油
XXI-16	H	CH ₃	H	2,5-F ₂	油
XXI-17	H	CH ₃	H	3-Cl,4-F	油
XXI-18	H	CH ₃	H	2-CF ₂	油
XXI-19	H	CH ₃	H	3-CF ₃	油
XXI-20	H	CH ₃	H	4-CF ₃	油
XXI-21	H	CH ₃	H	2-OCH ₃	油
XXI-22	H	CH ₃	H	3-OCH ₃	油
XXI-23	H	CH ₃	H	4-OCH ₃	油
XXI-24	H	CH ₃	H	3-SO ₂ C ₂ H ₅	油
XXI-25	H	CH ₃	H	4-SO ₂ C ₂ H ₅	89
XXI-26	H	CH ₃	H	3-NO ₂	油
XXI-27	H	CH ₃	H	4-OCF ₃	油
XXI-28	H	CH ₃	H	4-OPh	油
XXI-29	H	CH ₃	H	4-SCH ₃	92
XXI-30	H	CH ₃	H	4-i-C ₃ H ₇	油
XXI-31	H	CH ₃	H	3,5-(CF ₃) ₂	63
XXI-32	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-F	油
XXI-33	H	Cl	H	4-F	油
XXI-34	H	Cl	H	4-CF ₃	油

10

20

30

40

実施例番号	W	X	Y	V ¹ /V ²	m. p. (°C)
XXI-35	H	CH ₃	CH ₃	4-Cl	油
XXI-36	CH ₃	CH ₃	H	4-F	油
XXI-37	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	油
XXI-38	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl	油
XXI-39	H	Cl	H	4-Cl	油
XXI-40	H	Cl	H	2,4-Cl ₂	油
XXI-41	H	Cl	H	3,4-Cl ₂	油
XXI-42	H	Cl	H	3,5-Cl ₂	油
XXI-43	H	Cl	H	2,4-F ₂	油
XXI-44	H	Cl	H	3-Cl-4-F	油
XXI-45	H	Cl	H	2,5-Cl ₂	油

10

20

【0456】

使用実施例

30

実施例A

カラシナハムシ試験（噴霧処理）

溶 媒： アセトン78重量部

ジメチルホルムアミド1.5重量部

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル0.5重量部

活性化合物の適切な製剤を製造するために、活性化合物1重量部を前記の量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤含有水で所望の濃度に希釈した。

【0457】

白菜の葉のディスクに所望濃度の活性化合物の製剤を噴霧し、乾燥させた後にカラシナハムシ（*Phaedon cochleariae*）の幼虫を生息させた。

40

【0458】

所望の期間後に、活性（％）を調べた。100％は、カラシナハムシ幼虫が全部死んだことを意味し；0％は、カラシナハムシ幼虫が全く死ななかったことを意味する。

【0459】

この試験で、例えば、製造実施例の下記の化合物は極めて有効であった：

【0460】

【表 4 3】

表A

植物に害を与える昆虫
カラシナハムシ試験

活性化合物	活性化合物の濃度 (g/ha)	7 日後の殺虫率 (%)
実施例 I-1-a-4	500	100

10

【0 4 6 1】

実施例 B

ヨトウガ試験（噴霧処理）

溶 媒： アセトン 7 8 重量部

ジメチルホルムアミド 1. 5 重量部

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル 0. 5 重量部

20

活性化合物の適切な製剤を製造するために、活性化合物 1 重量部を前記の量の溶媒及び
乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤含有水で所望の濃度に希釈した。

【0 4 6 2】

トウモロコシの葉のディスクに所望濃度の活性化合物の製剤を噴霧し、乾燥させた後に
ヨトウガ (*Spodoptera frugiperda*) の毛虫を生息させた。

【0 4 6 3】

所望の期間後に、活性 (%) を調べた。1 0 0 % は毛虫全部が死んだことを意味し； 0
% は毛虫が全く死ななかったことを意味する。

【0 4 6 4】

この試験で、例えば、製造実施例の下記の化合物は極めて有効であった：

30

【0 4 6 5】

【表 4 4】

表B

植物に害を与える昆虫
ヨトウガ試験

活性化合物	活性化合物の濃度 (g/ha)	7 日後の殺虫率 (%)
実施例 I-1-b-4	500	100
実施例 I-1-c-4	500	100

40

【0 4 6 6】

実施例 C

ネコブセンチュウ試験

50

溶 媒： ジメチルホルムアミド 7 重量部

活性化合物の適切な製剤を製造するために、活性化合物 1 重量部を前記の量の溶媒と混合し、得られた濃厚物を水で所望の濃度に希釈した。

【0467】

容器に、砂、活性化合物の溶液、ネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*) の卵／幼虫懸濁物及びレタスの種子を満たした。レタスの種子を発芽させ、該植物を生長させた。根に瘤が形成された。

【0468】

所望の期間後に、殺線虫作用を瘤の形成％で調べた。100％は、瘤が認められなかったことを意味する；0％は、処理植物の瘤の個数が未処理対照の瘤の個数に相当することを意味する。

【0469】

この試験では、製造実施例の次の化合物は極めて有効である：

【0470】

【表45】

表C

植物に害を与える線虫
ネコブセンチュウ試験

活性化合物	活性化合物の濃度 ppm	14日後の効果 (%)
実施例 I-1-a-1	20	80
実施例 I-1-b-1	20	90
実施例 I-2-c-6	20	90

【0471】

実施例 D

モモアカアブラムシ試験（噴霧処理）

溶 媒： アセトン 78 重量部

ジメチルホルムアミド 1.5 重量部

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル 0.5 重量部

活性化合物の適切な製剤を製造するために、活性化合物 1 重量部を前記の量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤含有水で所望の濃度に希釈した。

【0472】

全ての期のモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) を生息させた白菜の葉のディスクに、所望濃度の活性化合物の製剤を噴霧した。

【0473】

所望の期間後に、活性（％）を調べた。100％は、モモアカアブラムシが全部死んだことを意味し；0％は、モモアカアブラムシが全く死ななかったことを意味する。

【0474】

この試験で、例えば、製造実施例の下記の化合物は極めて有効であった：

【0475】

【表 4 6】

表D

植物に被害を与える昆虫
モモアカアブラムシ試験

活性化合物	活性化合物の濃度 (g/ha)	5日後の殺虫率 (%)
実施例 I-2-c-6	100	100
実施例 I-1-c-1	100	100
実施例 I-1-b-33	100	100
実施例 I-2-a-32	500	90
実施例 I-1-b-11	500	100
実施例 I-1-c-15	500	100
実施例 I-1-b-14	500	100
実施例 I-2-b-15	500	100
実施例 I-2-c-16	500	100
実施例 I-1-b-17	500	90
実施例 I-2-b-21	500	100
実施例 I-1-b-26	500	100
実施例 I-2-b-13	500	100
実施例 I-1-b-30	500	100
実施例 I-2-b-31	500	100
実施例 I-2-b-30	500	100

【0 4 7 6】

実施例 E

カラシナハムシ試験（噴霧処理）

溶 媒： アセトン 7 8 重量部

ジメチルホルムアミド 1 . 5 重量部

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル 0 . 5 重量部

活性化合物の適切な製剤を製造するために、活性化合物 1 重量部を前記の量の溶媒及び
乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤含有水で所望の濃度に希釈した。

【0 4 7 7】

白菜の葉のディスクに所望濃度の活性化合物の製剤を噴霧し、乾燥させた後にカラシナ
ハムシ (Phaedon cochleariae) の幼虫を生息させた。

【0 4 7 8】

所望の期間後に、活性（％）を調べた。100％は、カラシナハムシ幼虫が全部死んだことを意味し；0％は、カラシナハムシ幼虫が全く死ななかったことを意味する。

【0479】

この試験で、例えば、製造実施例の下記の化合物は極めて有効であった：

【0480】

【表47】

表E

植物に害を与える昆虫
カラシナハムシ試験

活性化合物	活性化合物の濃度 (g/ha)	7日後の殺虫率 (%)
実施例 I-1-b-1	500	100
実施例 I-1-c-1	100	100
実施例 I-1-a-13	500	100
実施例 I-2-a-13	500	100
実施例 I-1-b-4	500	100
実施例 I-1-b-13	500	100
実施例 I-1-c-15	500	100
実施例 I-2-c-4	500	100
実施例 I-2-c-7	500	100
実施例 I-1-c-9	500	100
実施例 I-1-c-14	500	100
実施例 I-1-b-16	500	100
実施例 I-2-c-12	500	100
実施例 I-2-c-9	500	100
実施例 I-2-c-11	500	100
実施例 I-1-b-27	500	100
実施例 I-2-a-26	500	100
実施例 I-2-c-14	500	100
実施例 I-2-c-15	500	100
実施例 I-2-b-17	500	100
実施例 I-2-c-17	500	100
実施例 I-2-b-19	500	100
実施例 I-2-c-19	500	100
実施例 I-2-b-32	500	100

【0481】

実施例 F

ヨトウガ試験（噴霧処理）

溶 媒： アセトン78重量部

ジメチルホルムアミド 1.5 重量部

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル 0.5 重量部

活性化合物の適切な製剤を製造するために、活性化合物 1 重量部を前記の量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤含有水で所望の濃度に希釈した。

【0482】

トウモロコシの葉のディスクに所望濃度の活性化合物の製剤を噴霧し、乾燥させた後にヨトウガ (*Spodoptera frugiperda*) の毛虫を生息させた。

【0483】

所望の期間後に、活性 (%) を調べた。100% は毛虫全部が死んだことを意味し；0% は毛虫が全く死ななかったことを意味する。

【0484】

この試験で、例えば、製造実施例の下記の化合物は極めて有効であった：

【0485】

【表 48】

表 F

植物に害を与える昆虫
ヨトウガ試験

活性化合物	活性化合物の濃度 (g/ha)	7 日後の殺虫率 (%)
実施例 I-2-a-6	500	100
実施例 I-1-b-11	500	100
実施例 I-1-c-13	500	83
実施例 I-1-b-15	500	100
実施例 I-2-b-3	500	83
実施例 I-2-c-3	500	100
実施例 I-2-b-5	500	100
実施例 I-2-c-5	500	100
実施例 I-2-b-15	500	100
実施例 I-1-b-17	500	100
実施例 I-1-c-17	500	83
実施例 I-2-b-20	500	100
実施例 I-2-c-20	500	100
実施例 I-1-c-18	500	100
実施例 I-2-b-2	500	100
実施例 I-2-c-2	500	83
実施例 I-2-c-13	500	100
実施例 I-1-b-32	100	100

【0486】

実施例 G

ナミハダニ試験 (OP 抵抗性 / 噴霧処理)

溶 媒： アセトン 78 重量部

ジメチルホルムアミド 1.5 重量部

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル 0.5 重量部

活性化合物の適切な製剤を製造するために、活性化合物 1 重量部を前記の量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を乳化剤含有水で所望の濃度に希釈した。

【0487】

全ての段階のナミハダニ (Tetranychus urticae) を多数生息させたインゲンマメの葉のディスクに、所望濃度の活性化合物の製剤を噴霧した。

【0488】

所望の期間後に、活性 (%) を調べた。100% はナミハダニ全部が死んだことを意味し；0% はナミハダニが全く死ななかったことを意味する。

10

【0489】

この試験で、例えば、製造実施例の下記の化合物は良好な活性を示した：

【0490】

【表 4 9】

表 G
植物に害を与える昆虫
ナミハダニ試験（OP 耐性／噴霧処理）

活性化合物	活性化合物の濃度 (g/ha)	5 日後の殺虫率 (%)
実施例 I-2-b-6	100	90
実施例 I-1-a-10	500	90
実施例 I-3-a-1	100	90
実施例 I-1-a-11	500	100
実施例 I-1-b-4	500	100
実施例 I-1-c-7	500	100
実施例 I-1-c-11	500	100
実施例 I-1-c-12	500	100
実施例 I-1-c-15	500	100
実施例 I-2-c-23	500	100
実施例 I-1-b-9	500	100
実施例 I-1-c-16	500	100
実施例 I-2-b-10	500	100
実施例 I-2-c-10	500	100
実施例 I-1-b-28	500	100
実施例 I-1-a-17	500	90
実施例 I-2-a-2	500	90
実施例 I-1-c-17	500	100
実施例 I-1-b-10	500	90
実施例 I-2-c-26	100	90
実施例 I-3-b-1	500	90
実施例 I-1-b-34	500	90

【0 4 9 1】

実施例 H

うどんこ病試験（キュウリ）／保護試験

溶 媒： N，N－ジメチルホルムアミド 4 9 重量部

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル 1 重量部

活性化合物の適切な製剤を製造するために、活性化合物 1 重量部を上記の量の溶媒及び乳化剤と混合し、次いで得られた濃厚物を水で所定の濃度まで希釈した。

【0 4 9 2】

保護活性について試験するために、キュウリの稚苗に、活性化合物の製剤を下記に示した施用量で噴霧した。処理後 1 日目に、前記稚苗にうどんこ病菌（*Sphaerotheca fuliginea*）の孢子懸濁液を接種した。次いで、前記稚苗を相対湿度 7 0

%及び温度 23℃の温室に入れた。

【0493】

評価は菌接種後7日目に行った。0%は対照の効果に相当する効果を意味し、これに対して100%の効果は感染が認められないことを意味する。

【0494】

【表50】

表H

うどんこ病試験（キュウリ）／保護試験

10

活性化化合物	活性化化合物の施用量 (g/ha)	効果 (%)
実施例 I-1-b-1	750	94
実施例 I-1-b-3	750	90
実施例 I-1-c-1	750	80

20

【0495】

実施例 I

微生物においてED₅₀を測定するための生体外試験

試験すべき活性化化合物のメタノール性溶液を、乳化剤PS16と混合し、ピペットでマイクロタイタープレートのウェルに移した。溶媒を蒸発させた後に、それぞれのウェルにジャガイモ／デキストロース培地200μlを加えた。

【0496】

予め、試験すべき真菌類の適切な濃度の孢子又は菌糸体を培地に加えた。

【0497】

得られた活性化化合物の濃度は、0.1、1、10及び100ppmであった。得られた
乳化剤の濃度は300ppmであった。

30

【0498】

次いで、プレートを振盪装置上で22℃で3から5日間、十分な増殖が未処理対照で認めることができるまで培養した。

【0499】

評価は、620nmの波長で光度測定法により行った。未処理対照と比較して菌の増殖の50%阻止を生じる活性化化合物の用量（ED₅₀）を、種々の濃度で測定したデータから算出した。

【0500】

【表 5 1】

表 I

微生物において E D₅₀を測定するための生体外試験

活性化化合物	微生物	ED ₅₀ 値
実施例 I-2-b-6	病原菌(Phytophthora cryptogea)	0.56
実施例 I-2-c-6	病原菌(Phytophthora cryptogea)	1.04
実施例 I-1-c-1	病原菌(Phytophthora cryptogea)	0.71

10

【0 5 0 1】

実施例 J

除草剤の発芽後作用

単子葉及び双子葉植物雑草及び作物植物の種子を、木質繊維製の鉢に入れた砂壤土に置き、土壌で覆い、良好な生育条件下の温室の中で栽培した。播種後 2 から 3 週間目に、試験植物を半葉期で処理した。水和剤 (WP) として製剤した試験化合物を、6 0 0 l / h a の水施用量 (換算) を用いて種々の用量で、湿潤剤 0 . 2 % を加え、植物の葉の部分に噴霧した。試験植物を温室で最適生育条件下で 3 週間保ち、製剤の効果を未処理対照との比較で視覚的に評価した〔除草剤効果 (%) : 効果 1 0 0 % = 植物が枯死した、効果 0 % = 対照植物と同様の効果〕。

20

【0 5 0 2】

【表 5 2】

温室		有効成分g/ha	カラムキ*	ドクミキ*属	エノコダ*キ属
実施例 I-1-c-1	発芽後	320	90	90	80
実施例 I-1-b-20	発芽後	320	80	80	90
実施例 I-1-a-12	発芽後	320	80	70	70
実施例 I-1-c-19	発芽後	320	70	80	100

30

温室	有効成分g/ha	ドクミキ*属	エノコダ*キ属	ヒメ属
Ex. I-1-a-22	320	100	90	70

【0 5 0 3】

実施例 K

限界濃度試験／土壌昆虫 — トランスジェニック植物の処理

40

供試昆虫：ディアブロチカ・バルテアタ (D i a b r o t i c a b a l t e a t a) — 土壌中の幼虫

溶 媒： アセトン 7 重量部

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル 1 重量部

活性化化合物の適切な製剤を製造するために、活性化化合物 1 重量部を前記の量の溶媒と混合し、前記の量の乳化剤を加え、次いで得られた濃厚物を水で所望の濃度に希釈した。

【0 5 0 4】

活性化化合物の製剤を土壌表面に注加した。ここでは、製剤中の活性化化合物の濃度は、実質的に重要ではなく、土壌の単位体積当たりの活性化化合物の量 (重量) [p p m (m g / l) で表される] だけが重要である。前記の土壌を 0 . 2 5 リットル容の鉢に満たし、鉢

50

を 20℃でこのまま放置した。

【0505】

調製後直ちに、栽培変種 YIELD GUARD（米国のモンサント社の商標）の発芽前のトウモロコシ 5 粒をそれぞれの鉢に置いた。2 日後に、処理土壤中に適切な試験昆虫を置いた。さらに 7 日後に、活性化合物の効果を、発芽したトウモロコシ植物の個数を数えることによって調べた（1 植物＝活性 20％）。

【0506】

実施例 L

オオタバコガ試験 — トランスジェニック植物の処理

溶 媒： アセトン 7 重量部

10

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル 1 重量部

活性化合物の適切な製剤を製造するために、活性化合物 1 重量部を前記の量の溶媒及び前記の量の乳化剤と混合し、次いで得られた濃厚物を水で所望の濃度に希釈した。

【0507】

栽培変種 Roundup Ready（米国のモンサント社の商標）のダイズ新芽を、所望濃度の活性化合物の製剤に浸漬することによって処理し、次いでこの葉が未だ湿っている間にオオタバコガ（Heliothis virescens）の毛虫を生息させた。

【0508】

所望の期間後に、前記昆虫の死亡数を調べた。

20

フロントページの続き

(51)Int.Cl.

F I

A 0 1 N 47/06 (2006.01)	A 0 1 N 43/90 1 0 3
A 0 1 P 3/00 (2006.01)	A 0 1 N 47/06 D
A 0 1 P 7/04 (2006.01)	A 0 1 P 3/00
A 0 1 P 13/00 (2006.01)	A 0 1 P 7/04
A 6 1 K 31/4152 (2006.01)	A 0 1 P 13/00
A 6 1 K 31/4162 (2006.01)	A 6 1 K 31/4152
A 6 1 K 31/50 (2006.01)	A 6 1 K 31/4162
A 6 1 K 31/501 (2006.01)	A 6 1 K 31/50
A 6 1 K 31/5025 (2006.01)	A 6 1 K 31/501
A 6 1 K 31/553 (2006.01)	A 6 1 K 31/5025
A 6 1 K 45/00 (2006.01)	A 6 1 K 31/553
A 6 1 P 33/14 (2006.01)	A 6 1 K 45/00
C 0 7 C 57/76 (2006.01)	A 6 1 P 33/14
C 0 7 C 69/616 (2006.01)	C 0 7 C 57/76
	C 0 7 C 69/616

- (72)発明者 ゲジング, エルンスト・ルドルフ・エフ
ドイツ国、4 0 6 9 9・エアクラートーホホダー、トリルザー・グラーパーベン・4
- (72)発明者 フオイヒト, デイーター
ドイツ国、6 5 7 6 0・エシユボーン、アム・ブルクグラーパーベン・7・アー
- (72)発明者 クツク, カール・ハインツ
ドイツ国、4 0 7 6 4・ランゲンフェルト、パストアーレー・シユトラーセ・3 0・アー
- (72)発明者 レーゼル, ペーター
ドイツ国、5 1 3 7 1・レバークーゼン、ロールシユトラーセ・9 0・アー
- (72)発明者 マルサム, オルガ
ドイツ国、5 1 5 0 3・レースラーテ、フォー・デーム・クロスターノフ・1 9
- (72)発明者 アーノルド, クリステイアン
ドイツ国、4 0 7 6 4・ランゲンフェルト、パストアーレー・シユトラーセ・4 2
- (72)発明者 アウラー, トーマス
ドイツ国、4 2 7 9 9・ライヒリンゲン、ロスレンブルク・4 4
- (72)発明者 ヒルズ, マルティン・ジエフリ
ドイツ国、6 5 5 1 0・イドシユタイン、アム・イトツエルグルント・5・ベー
- (72)発明者 ケーネ, ハインツ
ドイツ国、6 5 7 1 9・ホフハイム、イルティスベーク・7・アー

合議体

審判長 門前 浩一

審判官 木村 敏康

審判官 井上 雅博

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

(58)調査した分野(Int.Cl., D B名)

C07D231/36, 487/00-487/22, 498/04

C A p l u s , R E G I S T R Y