

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2012-511525
(P2012-511525A)

(43) 公表日 平成24年5月24日(2012.5.24)

(51) Int.Cl.

C07D 417/14 (2006.01)
AO1P 3/00 (2006.01)
AO1N 43/78 (2006.01)

F 1

C07D 417/14
AO1P 3/00
AO1N 43/78

C S P
B

テーマコード(参考)

4 C 0 6 3
4 H 0 1 1

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 94 頁)

(21) 出願番号 特願2011-539923 (P2011-539923)
(86) (22) 出願日 平成21年11月28日 (2009.11.28)
(85) 翻訳文提出日 平成23年8月4日 (2011.8.4)
(86) 國際出願番号 PCT/EP2009/008492
(87) 國際公開番号 WO2010/066353
(87) 國際公開日 平成22年6月17日 (2010.6.17)
(31) 優先権主張番号 08171392.7
(32) 優先日 平成20年12月11日 (2008.12.11)
(33) 優先権主張国 歐州特許庁 (EP)

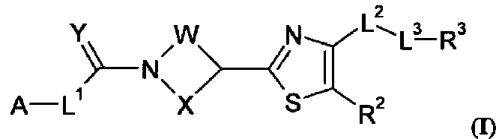
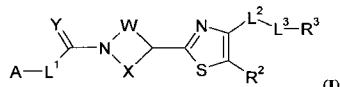
(71) 出願人 507203353
バイエル・クロップサイエンス・アーゲー
BAYER CROPSCIENCE AG
ドイツ国、40789・モンハイム、アル
フレートーノベルーシュトラーセ・50
(74) 代理人 110001173
特許業務法人川口國際特許事務所
(72) 発明者 クリスト、ピエール
フランス国、69009・リヨン、リュ・
マリエトン・4
(72) 発明者 ラーン、ニコラ
ドイツ国、40589・デュッセルドルフ
、アム・シュタインブリュック・17

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】植物保護剤としてのチアゾリルオキシムエーテルおよびヒドラゾン

(57) 【要約】

本発明は、式(I)



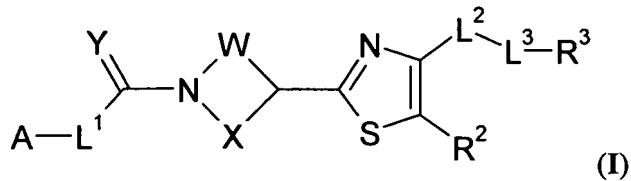
(式中、A、L¹、L²、Y、W、X、R¹、R²、R³、R⁵、R⁶およびR⁷の記号は、本明細書に示した意味を有する。)のチアゾリルオキシムエーテルおよびヒドラゾン、ならびに農芸化学的に有効なこれらの塩、ならびに植物病原性の真菌性有害生物を駆除するためのこれらの使用、植物病原性の真菌性有害生物を駆除するための方法、ならびに式(I)の化合物を生成するための方法に関する。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



10

(式中、記号は以下の意味を有し、

A は、メチルを表し、

または

A は、非置換または置換されたフェニルを表し、

ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

シアノ、ニトロ、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、C₄ - C₁₀ - シクロアルキルアルキル、C₄ - C₁₀ - アルキルシクロアルキル、C₅ - C₁₀ - アルキルシクロアルキルアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、トリ(C₁ - C₂ - アルキル)シリル、ベンジル、フェニル、ヒドロキシル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、OCH₂OCH₃、SH、C₁ - C₄ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - ハロアルキルチオ、CHO、COOH、(C₁ - C₄ - アルコキシ)カルボニル、CONR⁴R⁵、CR⁴=NOR⁵、(C₁ - C₄ - アルキル)カルボニル、(C₁ - C₄ - ハロアルキル)カルボニル、(C₁ - C₄ - アルキル)カルボニルチオ、(C₁ - C₄ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルフィニル、C₁ - C₄ - アルキルスルホニル、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルホニル、NR⁴R⁵、NR⁴COR⁵、SF₅、SO₂NR⁴R⁵、C₂ - C₄ - アルコキシアルキルまたは1-メトキシシクロプロピル、

20

から選択され、

30

または

A は、ベンゾ縮合していてよい非置換または置換された 5 員または 6 員のヘテロアリールを表し、ここで置換基は互いに独立して下記一覧：

炭素における置換基：

シアノ、ニトロ、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、C₄ - C₁₀ - シクロアルキルアルキル、C₄ - C₁₀ - アルキルシクロアルキル、C₅ - C₁₀ - アルキルシクロアルキルアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、トリ(C₁ - C₂ - アルキル)シリル、ベンジル、フェニル、ヒドロキシル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、OCH₂OCH₃、SH、C₁ - C₄ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - ハロアルキルチオ、CHO、COOH、(C₁ - C₄ - アルコキシ)カルボニル、CONR⁴R⁵、CR⁴=NOR⁵、(C₁ - C₄ - アルキル)カルボニル、(C₁ - C₄ - ハロアルキル)カルボニル、(C₁ - C₄ - アルキル)カルボニルチオ、(C₁ - C₄ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルフィニル、C₁ - C₄ - アルキルスルホニル、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルホニル、NR⁴R⁵、NR⁴COR⁵、SF₅、SO₂NR⁴R⁵、C₂ - C₄ - アルコキシアルキルまたは1-メトキシシクロプロピル、

40

窒素における置換基：ヒドロキシル、NR⁴R⁵、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、C₃ -

50

C_6 - シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ - ハロシクロアルキル、 $C_4 - C_{10}$ - アルキルシクロアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニルまたは $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、

から選択され、

L^1 は、 $(C(R^1)_2)_n$ を表し、

ここで、 $n = 0$ から 3 であり、

R^1 は、同一でありまたは異なり、互いに独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 - C_2$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキルまたはシアノを表し、

ただし、 L^1 が、最大でも 4 つの水素と異なる R^1 を含有することができるという条件であり、

10

Y は、硫黄または酸素を表し、

W は、非置換または一置換の $C_1 - C_3$ - 炭素鎖を表し、ここで、置換基はオキソ、ヒドロキシリル、シアノおよび $C_1 - C_4$ - アルキルからなる群から選択され、

X は、非置換または一置換の $C_1 - C_2$ - 炭素鎖を表し、ここで、置換基はオキソ、ヒドロキシリル、シアノおよび $C_1 - C_4$ - アルキルからなる群から選択され、

R^2 は、水素、 $C_1 - C_2$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキルまたはハロゲンを表し、

L^2 は、 $-CH=N-O-$ 、 $-C(R^6)=N-O-$ 、 $-CH=N-N(R^7)-$ または $-C(R^6)=N-N(R^7)-$ を表し、

L^3 は、直接結合を表し、

20

または

L^3 は、最大 4 個までの置換基を含有することができる $C_1 - C_4$ - 炭素鎖を表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

ハロゲン、 $C_1 - C_2$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - アルコキシ、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキルまたは $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、

から選択され、

R^3 は、メチル、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキル、 $-CH=CH_2$ 、 $-C(CH_3)_2$ または非置換もしくは一置換の $C_3 - C_{10}$ - シクロアルキルを表し、ここで、置換基は下記一覧：

シアノ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、トリ($C_1 - C_2$ - アルキル)シリル、フェニル、ヒドロキシリル、オキソ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオまたは $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ、

30

から選択され、

または

R^3 は、非置換または置換されたフェニルを表し、

ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ - ハロシクロアルキル、 $C_4 - C_{10}$ - シクロアルキルアルキル、 $C_4 - C_{10}$ - ハロシクロアルキルアルキル、 $C_4 - C_{10}$ - アルキルシクロアルキル、 $C_5 - C_{10}$ - アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_4 - C_{10}$ - シクロアルコキシアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルケニル、 $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、 $C_2 - C_6$ - アルコキシリアルキル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルコキシリアルキル、 $C_3 - C_8$ - アルコキシリアルコキシリアルキル、トリ($C_1 - C_2$ - アルキル)シリル、ベンジル、フェニル、ヒドロキシリル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_2 - C_6$ - アルコキシリアルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - ハ

50

ロアルキニルオキシ、 $C_3 - C_6$ - シクロアルコキシ、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルオキシ、 $C_3 - C_6$ - ハロシクロアルコキシ、 $C_4 - C_{10}$ - シクロアルキルアルキルオキシ、 $NR^4 R^5$ 、 SH 、 SF_5 、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ、 $C_2 - C_6$ - アルキルアルキルチオ、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルチオ、 CHO 、 $COOH$ 、($C_1 - C_6$ - アルコキシ)カルボニル、 $CONR^4 R^5$ 、 $CR^4 = NOR^5$ 、($C_1 - C_6$ - アルキル)カルボニル、($C_1 - C_6$ - ハロアルキル)カルボニル、($C_1 - C_6$ - アルキル)カルボニルオキシ、($C_1 - C_6$ - ハロアルキル)カルボニルオキシ、($C_1 - C_6$ - アルキル)カルボニルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルホニル、 $NR^4 COR^5$ または $SO_2 NR^4 R^5$

10

から選択され、

または

R^3 は、飽和または部分的もしくは完全不飽和のナフチルまたはインデニルを表し、これは最大 2 個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

シアノ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、トリ($C_1 - C_2$ - アルキル)シリル、フェニル、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオまたは $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ、

20

から選択され、

または

R^3 は、非置換または置換された 5 員または 6 員のヘテロアリール基を表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

炭素における置換基：シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ - ハロシクロアルキル、 $C_4 - C_{10}$ - シクロアルキルアルキル、 $C_4 - C_{10}$ - アルキルシクロアルキル、 $C_5 - C_10$ - アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、トリ($C_1 - C_2$ - アルキル)シリル、ベンジル、フェニル、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 OCH_2OCH_3 、 SH 、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ、 $COOH$ 、($C_1 - C_4$ - アルコキシ)カルボニル、 $CONR^6 R^7$ 、($C_1 - C_4$ - アルキル)カルボニル、($C_1 - C_4$ - ハロアルキル)カルボニル、($C_1 - C_4$ - アルキル)カルボニルオキシ、($C_1 - C_4$ - アルキル)カルボニルチオ、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルホニル、 $NR^4 R^5$ 、 $NR^4 COR^5$ 、 SF_5 、 $SO_2 NR^4 R^5$ 、 $C_2 - C_4$ - アルコキシアルキルまたは 1 - メトキシシクロプロピル、

30

窒素における置換基：ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ - ハロシクロアルキル、 $C_4 - C_{10}$ - アルキルシクロアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニルまたはフェニル、

40

から選択され、

または

R^3 は、最大 2 個までの置換基を含有することができるベンゾ縮合した非置換または置換された 5 員または 6 員のヘテロアリールを表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

炭素における置換基：シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ - ハロシクロアルキル、 $C_4 - C_4$ -

50

C_{1-0} - シクロアルキルアルキル、 C_4-C_{1-0} - アルキルシクロアルキル、 C_5-C_1
 $_0$ - アルキルシクロアルキルアルキル、 C_2-C_6 - アルケニル、 C_2-C_6 - ハロアル
ケニル、 C_2-C_6 - アルキニル、 C_2-C_6 - ハロアルキニル、トリ(C_1-C_2 - ア
ルキル)シリル、ベンジル、フェニル、ヒドロキシル、 C_1-C_4 - アルコキシ、 C_1
- C_4 - ハロアルコキシ、 OCH_2OCH_3 、 SH 、 C_1-C_4 - アルキルチオ、 C_1-C
 $_6$ - ハロアルキルチオ、 $COOH$ 、(C_1-C_4 - アルコキシ)カルボニル、 $CONR^4$
 R^5 、(C_1-C_4 - アルキル)カルボニル、(C_1-C_4 - ハロアルキル)カルボニル
、(C_1-C_4 - アルキル)カルボニルオキシ、(C_1-C_4 - アルキル)カルボニルチ
オ、 C_1-C_4 - アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 - ハロアルキルスルフィニル、 C_1
- C_4 - アルキルスルホニル、 C_1-C_4 - ハロアルキルスルホニル、 NR^4R^5 、 NR
 $^4COR^5$ 、 SF_5 、 $SO_2NR^4R^5$ 、 C_2-C_4 - アルコキシアルキルまたは 1 -メ
トキシシクロプロピル、

窒素における置換基 : C_1-C_6 - アルキル、 C_1-C_3 - ハロアルキル、 C_3-C_6 -
シクロアルキル、 C_3-C_6 - ハロシクロアルキル、 C_4-C_{1-0} - アルキルシクロアル
キル、 C_2-C_6 - アルケニル、 C_2-C_6 - ハロアルケニル、 C_2-C_6 - アルキニル
、 C_2-C_6 - ハロアルキニルまたはフェニル、

から選択され、

または

R^3 は、炭素原子を介して結合され、窒素、酸素および硫黄からなる群から選択され
る最大 2 個までのさらなるヘテロ原子を含有することができる非置換または一置換の 5 員
から 15 員のヘテロシクリル基を表し、ここで、置換基は下記一覧 :

炭素における置換基 : シアノ、ハロゲン、 C_1-C_6 - アルキル、 C_1-C_3 - ハロアル
キル、 C_3-C_6 - シクロアルキル、 C_2-C_6 - アルケニル、 C_2-C_6 - ハロアルケ
ニル、 C_2-C_6 - アルキニル、 C_2-C_6 - ハロアルキニル、トリ(C_1-C_2 - ア
ルキル)シリル、フェニル、ヒドロキシル、 C_1-C_6 - アルコキシ、 C_1-C_6 - ハロア
ルコキシ、 C_2-C_6 - アルケニルオキシ、 C_2-C_6 - アルキニルオキシ、 C_1-C_6
- アルキルチオまたは C_1-C_6 - ハロアルキルチオ、

窒素における置換基 : C_1-C_6 - アルキル、 C_1-C_3 - ハロアルキル、 C_3-C_6 -
シクロアルキル、 C_2-C_6 - アルケニル、 C_2-C_6 - ハロアルケニル、 C_2-C_6 -
アルキニル、 C_2-C_6 - ハロアルキニル、トリ(C_1-C_2 - アルキル)シリルまたは
フェニル、

から選択され、

R^4 、 R^5 は、互いに独立して、水素、 C_1-C_4 - アルキル、 C_1-C_3 - ハロアル
キル、 C_3-C_6 - シクロアルキルまたはフェニルを表し、

R^6 は、 C_1-C_4 - アルキル、 C_1-C_3 - ハロアルキル、 C_3-C_6 - シクロアル
キルまたはフェニルを表し、

R^7 は、水素、 C_1-C_4 - アルキル、 C_1-C_3 - ハロアルキル、 C_3-C_6 - シ
クロアルキルまたはフェニルを表し、

または

L^2 が $-CH=N-N(R^7)$ - 基または $-C(R^6)=N-N(R^7)$ - 基を表す
場合、

2 個の基 R^7 および R^3 は、 L^3 を介してこれらが結合している窒素原子と一緒になって
、 N 、 O および S からなる群から選択される最大 2 個までのさらなるヘテロ原子を含有す
ることができる 5 員から 8 員の非置換または置換された飽和または部分飽和または不飽和
のヘテロ環を形成し、ここで、2 個の酸素原子は隣接せず、

ここで、可能な置換基は、互いに独立して、 C_1-C_4 - アルキル、 C_1-C_4 - アルコ
キシ、ヒドロキシルおよびハロゲンからなる群から選択される。)

の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の式(I)

10

20

30

40

50

(式中、記号は下記の意味を有し、

A は、メチルを表し、

または

A は、最大 2 個までの置換基を含有することができるフェニルを表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

シアノ、ニトロ、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - アルキニル、ヒドロキシル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、C₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、(C₁ - C₄ - アルコキシ)カルボニル、(C₁ - C₄ - アルキル)カルボニル、(C₁ - C₄ - ハロアルキル)カルボニル、C₁ - C₄ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルフィニル、C₁ - C₄ - アルキルスルホニルまたはC₁ - C₄ - ハロアルキルスルホニル、

から選択され、

または

A は、下記の群：フラン - 2 - イル、フラン - 3 - イル、チオフェン - 2 - イル、チオフェン - 3 - イル、イソオキサゾール - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イル、イソオキサゾール - 5 - イル、1H - ピロール - 1 - イル、1H - ピロール - 2 - イル、1H - ピロール - 3 - イル、オキサゾール - 2 - イル、オキサゾール - 4 - イル、オキサゾール - 5 - イル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イル、チアゾール - 5 - イル、イソチアゾール - 3 - イル、イソチアゾール - 4 - イル、イソチアゾール - 5 - イル、ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イル、イミダゾール - 1 - イル、イミダゾール - 2 - イル、イミダゾール - 4 - イル、1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル、1, 2, 4 - オキサジアゾール - 5 - イル、1, 3, 4 - オキサジアゾール - 1 - イル、1, 2, 4 - チアジアゾール - 3 - イル、1, 2, 4 - チアジアゾール - 5 - イル、1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル、1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル、1, 2, 3 - トリアゾール - 2 - イル、1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - イル、1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル、1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、ピリダジン - 3 - イル、ピリダジン - 4 - イル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イル、ピラジン - 2 - イル、1, 3, 5 - トリアジン - 2 - イル、1, 2, 4 - トリアジン - 3 - イル、1H - インドール - 1 - イル、1H - インドール - 2 - イル、1H - インドール - 3 - イル、1H - インドール - 4 - イル、1H - インドール - 5 - イル、1H - インドール - 6 - イル、1H - インドール - 7 - イル、1H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル、1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル、1H - ベンゾイミダゾール - 4 - イル、ベンゾイミダゾール - 5 - イル、1H - インダゾール - 1 - イル、1H - インダゾール - 3 - イル、1H - インダゾール - 4 - イル、1H - インダゾール - 5 - イル、1H - インダゾール - 6 - イル、1H - インダゾール - 7 - イル、2H - インダゾール - 2 - イル、1 - ベンゾフラン - 2 - イル、1 - ベンゾフラン - 3 - イル、1 - ベンゾフラン - 4 - イル、1 - ベンゾフラン - 5 - イル、1 - ベンゾフラン - 6 - イル、1 - ベンゾフラン - 7 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 2 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 3 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 4 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 5 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 6 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 7 - イル、1, 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル、1, 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル、キノリン - 2 - イル、キノリン - 3 - イル、キノリン - 4 - イル、キノリン - 5 - イル、キノリン - 6 - イル、キノリン - 7 - イル、キノリン - 8 - イル、イソキノリン - 1 - イル、イソキノリン - 3 - イル、イソキノリン - 4 - イル、イソキノリン - 5 - イル、イソキノリン - 6 - イル、イソキノリン - 7 - イルまたはイソキノリン - 8 - イル、

から選択される複素芳香族基を表し、

これらは最大 2 個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

10

20

30

40

50

炭素における置換基：シアノ、ニトロ、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、ヒドロキシル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオまたはC₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、

窒素における置換基：C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、シクロプロピル、C₂ - C₄ - アルケニルまたはC₂ - C₄ - アルキニル、

から選択され、

L¹は、(C(R¹)₂)_nを表し、

ここで、n = 0 から 2 であり、

R¹は、同一でありまたは異なり、互いに独立して、水素、塩素、フッ素、メチル、CF₃またはシアノを表し、

ただし、L¹が、最大でも 2 つの水素と異なるR¹を含有することができるという条件であり、

Yは、硫黄または酸素を表し、

Wは、非置換または一置換のC₁ - から C₂ - 炭素鎖を表し、ここで、置換基はシアノおよびC₁ - C₂ - アルキルからなる群から選択され、

Xは、非置換または一置換のC₁ - から C₂ - 炭素鎖を表し、ここで、置換基はシアノおよびC₁ - C₂ - アルキルからなる群から選択され、

R²は、水素、C₁ - C₂ - アルキルまたはハロゲンを表し、

L²は、-CH=N-O-、-C(R⁶)=N-O-、-CH=N-N(R⁷)-または-C(R⁶)=N-N(R⁷)-を表し、

L³は、直接結合を表し、

または

L³は、最大 2 個までの置換基を含有することができるC₁ - から C₄ - 炭素鎖を表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₂ - アルコキシ、C₁ - C₂ - ハロアルキルまたはシクロプロピル、

から選択され、

R³は、非置換または一置換のC₃ - C₁₀ - シクロアルキルを表し、ここで、置換基は下記一覧：

ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、トリ(C₁ - C₂ - アルキル)シリル、フェニルまたはオキソ、

から選択され、

または

R³は、最大 3 個までの置換基を含有することができるフェニルを表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

シアノ、ニトロ、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、トリ(C₁ - C₂ - アルキル)シリル、フェニル、ヒドロキシル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオまたはC₁ - C₆ - ハロアルキルチオ、

から選択され、

または

R³は、ナフタレン-1-イル、ナフタレン-2-イル、1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル、1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-2-イル、5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-1-イル、5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-2-イル、デカリン-1-イル、デカリン-2-イル、1H-インデン-1-イル、1H-インデン-2-イル、1H-インデン-3-イル、1H-インデン-4-イル、1H-インデン-5-イル、1H-インデン-6-イル、1H-インデン-7-イル、2

, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル、2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 2 - イル、2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イルまたは2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 5 - イル、

を表し、

これらは最大 2 個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

シアノ、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、フェニル、ヒドロキシル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₃ - ハロアルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオまたはC₁ - C₃ - ハロアルキルチオ、

から選択され、

または

R³ は、フラン - 2 - イル、フラン - 3 - イル、チオフェン - 2 - イル、チオフェン - 3 - イル、イソオキサゾール - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イル、イソオキサゾール - 5 - イル、1 H - ピロール - 1 - イル、1 H - ピロール - 2 - イル、1 H - ピロール - 3 - イル、オキサゾール - 2 - イル、オキサゾール - 4 - イル、オキサゾール - 5 - イル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イル、チアゾール - 5 - イル、イソチアゾール - 3 - イル、イソチアゾール - 4 - イル、イソチアゾール - 5 - イル、ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イル、イミダゾール - 1 - イル、イミダゾール - 2 - イル、イミダゾール - 4 - イル、1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル、1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 5 - イル、1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル、1 , 2 , 4 - チアジアゾール - 3 - イル、1 , 2 , 4 - チアジアゾール - 5 - イル、1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - イル、1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル、1 , 2 , 3 - トリアゾール - 2 - イル、1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル、1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル、1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、ピリダジン - 3 - イル、ピリダジン - 4 - イル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イル、ピラジン - 2 - イル、1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イルまたは1 , 2 , 4 - トリアジン - 3 - イル、

を表し、

これらは最大 2 個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

炭素における置換基：シアノ、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、フェニル、ヒドロキシル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオまたはC₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、

窒素における置換基：C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニルまたはフェニル、

から選択され、

または

R³ は、1 H - インドール - 1 - イル、1 H - インドール - 2 - イル、1 H - インドール - 3 - イル、1 H - インドール - 4 - イル、1 H - インドール - 5 - イル、1 H - インドール - 6 - イル、1 H - インドール - 7 - イル、1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル、1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル、1 H - ベンゾイミダゾール - 4 - イル、ベンゾイミダゾール - 5 - イル、1 H - インダゾール - 1 - イル、1 H - インダゾール - 3 - イル、1 H - インダゾール - 4 - イル、1 H - インダゾール - 5 - イル、1 H - インダゾール - 6 - イル、1 H - インダゾール - 7 - イル、2 H - インダゾール - 2 - イル、1 - ベンゾフラン - 2 - イル、1 - ベンゾフラン - 3 - イル、1 - ベンゾフラン - 4 - イル、1 - ベンゾフラン - 5 - イル、1 - ベンゾフラン - 6 - イル、1 - ベンゾフラン - 7 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 2 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 3 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 4 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 5 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 6 - イ

ル、1-ベンゾチオフェン-7-イル、キノリン-2-イル、キノリン-3-イル、キノリン-4-イル、キノリン-5-イル、キノリン-6-イル、キノリン-7-イル、キノリン-8-イル、イソキノリン-1-イル、イソキノリン-3-イル、イソキノリン-4-イル、イソキノリン-5-イル、イソキノリン-6-イル、イソキノリン-7-イルまたはイソキノリン-8-イル、

を表し、

これらは最大2個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

炭素における置換基：シアノ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_3$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、フェニル、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオまたは $C_1 - C_4$ -ハロアルキルチオ、

窒素における置換基： $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_3$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニルまたはフェニル、から選択され、

または

R^3 は、炭素原子を介して結合し、窒素、酸素および硫黄からなる群から選択される最大2個までのさらなるヘテロ原子を含有することができる非置換または一置換の5員から6員のヘテロシクリル基を表し、ここで、置換基は下記一覧：

炭素における置換基： $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_3$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、トリ($C_1 - C_2$ -アルキル)シリルまたはフェニル、

窒素における置換基： $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、トリ($C_1 - C_2$ -アルキル)シリルまたはフェニル、

から選択され、

R^6 は、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_2$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキルまたはフェニルを表し、

R^7 は、水素、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_2$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキルまたはフェニルを表し、

または

L^2 が $-CH = N - N(R^7)$ -基または $-C(R^6) = N - N(R^7)$ -基を表す場合、

2個の基 R^7 および R^3 は、 L^3 を介してこれらが結合している窒素原子と一緒にになって、N、OおよびSからなる群から選択される最大2個までのさらなるヘテロ原子を含有することができる5員から8員の非置換または置換された飽和または部分飽和または不飽和のヘテロ環を形成し、ここで、2個の酸素原子は隣接せず、

ここで、可能な置換基は互いに独立して、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、ヒドロキシルおよびハロゲンからなる群から選択される。)

の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩。

【請求項3】

請求項1から2の一項以上に記載の式(I)

(式中、記号は下記の意味を有し、

Aは、メチルを表し、

または

Aは、最大2個までの置換基を含有することができるフェニルを表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 - C_2$ -アルキル、 $C_1 - C_2$ -ハロアルキル、ヒドロキシル、 $C_1 - C_2$ -アルコキシまたは $C_1 - C_2$ -ハロアルコキシ、

から選択され、

10

20

30

40

50

または

A は、下記の群：フラン - 2 - イル、フラン - 3 - イル、チオフェン - 2 - イル、チオフェン - 3 - イル、オキサゾール - 2 - イル、オキサゾール - 4 - イル、オキサゾール - 5 - イル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イル、チアゾール - 5 - イル；ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イル、イミダゾール - 1 - イル、イミダゾール - 2 - イル、イミダゾール - 4 - イル、1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イルまたはピリジン - 4 - イル、から選択される複素芳香族基を表し、

これらは最大 2 個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

10

炭素における置換基：シアノ、ハロゲン、C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₂ - ハロアルキル、ヒドロキシリル、C₁ - C₂ - アルコキシまたはC₁ - C₂ - ハロアルコキシ、

窒素における置換基：C₁ - C₂ - アルキルまたはC₁ - C₂ - ハロアルキル、

から選択され、

L¹ は、(C(R¹)₂)_n を表し、

ここで、n = 1 または 2 であり、

R¹ は、同一であります異なり、互いに独立して水素、またはメチルを表し、ただし、L¹ が最大でも 2 個のメチル置換基を含有することができるという条件であり、

Y は、硫黄または酸素を表し、

W は、-CH₂CH₂- を表し、

X は、-CH₂CH₂- を表し、

R² は、水素、メチル、塩素または臭素を表し、

20

L² は、-CH=N-O-、-C(R⁶)=N-O-、-CH=N-N(R⁷)- または -C(R⁶)=N-N(R⁷)- を表し、

L³ は、直接結合を表し、

または

L³ は、最大 2 個までの置換基を含有することができる C₁ - から C₄ - 炭素鎖を表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

メチル、メトキシまたは CF₃、

から選択され、

30

R³ は、非置換または一置換の C₃ - C₁₀ - シクロアルキルを表し、ここで、置換基は下記の一覧：

フッ素、塩素、メチル、エチル、シクロプロピル、シクロペンチルまたはシクロヘキシリル、

から選択され、

または

R³ は、最大 3 個までの置換基を含有することができるフェニルを表し、ここで、置換基は互いに独立して下記の一覧：

シアノ、ニトロ、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、フェニル、ヒドロキシリル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオまたはC₁ - C₆ - ハロアルキルチオ、

40

から選択され、

または

R³ は、ナフタレン - 1 - イル、ナフタレン - 2 - イル、1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル、1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 2 - イル、5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル、5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 2 - イル、デカリニン - 1 - イル、デカリニン - 2 - イル、1H - インデン - 1 - イル、1H - インデン - 2 - イル、1H - インデン - 3 - イル、1H - インデン - 4 - イル、1H - インデン - 5 - イル、1H - インデン - 6 - イル、1H - インデン - 7 - イル、2 , 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル、2 , 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 2 -

50

イル、2、3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イルまたは2、3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イル、
を表し、

これらは最大2個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、CF₃、CHF₂、シクロプロピル、フェニル、ヒドロキシル、OMe、OEt、OCF₃、OC HF₂、OC₂F₅、SM_eまたはSCF₃、

から選択され、

または

R³は、フラン-2-イル、フラン-3-イル、チオフェン-2-イル、チオフェン-3-イル、イソオキサゾール-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、イソオキサゾール-5-イル、1H-ピロール-1-イル、1H-ピロール-2-イル、1H-ピロール-3-イル、オキサゾール-2-イル、オキサゾール-4-イル、オキサゾール-5-イル、チアゾール-2-イル、チアゾール-4-イル、チアゾール-5-イル、イソチアゾール-3-イル、イソチアゾール-4-イル、イソチアゾール-5-イル、ピラゾール-1-イル、ピラゾール-3-イル、ピラゾール-4-イル、イミダゾール-1-イル、イミダゾール-2-イル、イミダゾール-4-イル、1,2,4-オキサジアゾール-3-イル、1,2,4-オキサジアゾール-5-イル、1,2,4-チアジアゾール-3-イル、1,2,4-チアジアゾール-5-イル、1,3,4-チアジアゾール-2-イル、1,2,3-トリアゾール-1-イル、1,2,3-トリアゾール-2-イル、1,2,3-トリアゾール-4-イル、1,2,4-トリアゾール-3-イル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、ピリダジン-3-イル、ピリダジン-4-イル、ピリミジン-2-イル、ピリミジン-4-イル、ピリミジン-5-イル、ピラジン-2-イル、1,3,5-トリアジン-2-イルまたは1,2,4-トリアジン-3-イル、

を表し、

これらは最大2個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

炭素における置換基：シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、1-メチルエチル、1,1-ジメチルエチル、CF₃、CHF₂、C₂F₅、CCl₃、シクロプロピル、フェニル、ヒドロキシル、OMe、OEt、OisoPr、OCF₃、OC HF₂、OC₂F₅、SM_eまたはSCF₃、

窒素における置換基：メチル、エチル、1-メチルエチル、1,1-ジメチルエチル、シクロプロピルまたはフェニル、

から選択され、

または

R³は、1H-インドール-1-イル、1H-インドール-2-イル、1H-インドール-3-イル、1H-インドール-4-イル、1H-インドール-5-イル、1H-インドール-6-イル、1H-インドール-7-イル、1H-ベンゾイミダゾール-1-イル、1H-ベンゾイミダゾール-2-イル、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル、ベンゾイミダゾール-5-イル、1H-インダゾール-1-イル、1H-インダゾール-3-イル、1H-インダゾール-4-イル、1H-インダゾール-5-イル、1H-インダゾール-6-イル、1H-インダゾール-7-イル、2H-インダゾール-2-イル、1-ベンゾフラン-2-イル、1-ベンゾフラン-3-イル、1-ベンゾフラン-4-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、1-ベンゾフラン-6-イル、1-ベンゾフラン-7-イル、1-ベンゾチオフェン-2-イル、1-ベンゾチオフェン-3-イル、1-ベンゾチオフェン-4-イル、1-ベンゾチオフェン-5-イル、1-ベンゾチオフェン-6-イル、1-ベンゾチオフェン-7-イル、キノリン-2-イル、キノリン-3-イル、キノ

10

20

30

40

50

リン - 4 - イル、キノリン - 5 - イル、キノリン - 6 - イル、キノリン - 7 - イル、キノリン - 8 - イル、イソキノリン - 1 - イル、イソキノリン - 3 - イル、イソキノリン - 4 - イル、イソキノリン - 5 - イル、イソキノリン - 6 - イル、イソキノリン - 7 - イルまたはイソキノリン - 8 - イル、

を表し、

これらは最大 2 個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

炭素における置換基：シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、1 - メチルエチル、1 , 1 - ジメチルエチル、 CF_3 、 CHF_2 、 C_2F_5 、 CCl_3 、シクロプロピル、フェニル、ヒドロキシリル、 OMe 、 OEt 、 OisoPr 、 OCF_3 、 OCHF_2 、 OC_2F_5 、 SMo または SCF_3 、

窒素における置換基：メチル、エチル、1 - メチルエチル、1 , 1 - ジメチルエチル、シクロプロピルまたはフェニル、

から選択され、

または

R^3 は、非置換または一置換のピロリジン - 2 - イル、ピロリジン - 3 - イル、モルホリン - 3 - イル、モルホリン - 2 - イル、ピペリジン - 2 - イル、ピペリジン - 3 - イルまたはピペラジン - 2 - イルを表し、ここで、置換基は下記一覧：

炭素における置換基：メチル、エチル、 CF_3 、シクロプロピルまたはフェニル、

窒素における置換基：メチル、エチル、シクロプロピルまたはフェニル、

から選択され、

R^6 は、メチル、エチル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシリルまたはフェニルを表し、

R^7 は、水素、メチル、エチル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシリルまたはフェニルを表し、

または

L^2 が $- \text{CH} = \text{N} - \text{N}(R^7) -$ 基または $- \text{C}(R^6) = \text{N} - \text{N}(R^7) -$ 基を表す場合、

2 個の基 R^7 および R^3 は、 L^3 を介してこれらが結合している窒素原子と一緒にになって、5 員または 6 員の非置換または置換された飽和または部分飽和または不飽和のヘテロ環を形成し、

ここで、可能な置換基は互いに独立して、メチル、エチル、 CF_3 、塩素およびフッ素からなる群から選択される。)

の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩。

【請求項 4】

請求項 1 から 3 の一項以上に記載の式 (I)

(式中、記号は下記の意味を有し、

A は、メチルを表し、

または

A は、最大 2 個までの置換基を含有することができるフェニルを表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、 CF_3 、 CHF_2 、 C_2F_5 、 CCl_3 、ヒドロキシリル、 OMe 、 OCF_3 、 OCHF_2 、 $\text{OC}_2\text{H}_2\text{CF}_3$ または OC_2F_5 、

から選択され、

または

A は、下記の群：ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イルまたはピリジン - 4 - イル、

から選択される複素芳香族基を表し、

これらは最大 2 個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して

10

20

30

40

50

下記一覧：

炭素における置換基：シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、 $C F_3$ 、 $C H F_2$ 、 $C_2 F_5$ 、 $C C l_3$ 、ヒドロキシル、 $O M e$ 、 $O C F_3$ 、 $O C H F_2$ 、 $O C H_2 C F_3$ または $O C_2 F_5$ 、

窒素における置換基：メチル、エチルまたは $C F_3$ 、

から選択され、

L^1 は、 $(C(R^1)_2)_n$ を表し、

ここで、 $n = 1$ または 2 であり、

R^1 は、同一でありまたは異なり、互いに独立して水素、またはメチルを表し、ただし、 L^1 が最大でも 1 個のメチル置換基を含有することができるという条件であり、

10

Y は、硫黄または酸素を表し、

W は、 $-C H_2 C H_2-$ を表し、

X は、 $-C H_2 C H_2-$ を表し、

R^2 は、水素またはメチルを表し、

L^2 は、 $-C H = N - O -$ 、 $-C(R^6) = N - O -$ 、 $-C H = N - N(R^7) -$ または $-C(R^6) = N - N(R^7) -$ を表し、

L^3 は、直接結合を表し、

または

L^3 は、最大 2 個までのメチル置換基を含有することができる $C_1 -$ から $C_2 -$ 炭素鎖を表し、

20

R^3 は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチルまたはシクロオクチルを表し、

または

R^3 は、最大 2 個までの置換基を含有することができるフェニルを表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、1 - メチルエチル、1, 1 - ジメチルエチル、 $C F_3$ 、 $C H F_2$ 、 $C_2 F_5$ 、 $C C l_3$ 、フェニル、ヒドロキシル、 $O M e$ 、 $O E t$ 、 $O i s o P r$ 、 $O C F_3$ 、 $O C H F_2$ 、 $O C_2 F_5$ 、 $S M e$ または $S C F_3$ 、

、

から選択され、

30

または

R^3 は、ナフタレン - 1 - イル、ナフタレン - 2 - イル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタレン - 2 - イル、5, 6, 7, 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル、5, 6, 7, 8 - テトラヒドロナフタレン - 2 - イル、デカリニン - 1 - イル、デカリニン - 2 - イル、1H - インデン - 1 - イル、1H - インデン - 2 - イル、1H - インデン - 3 - イル、1H - インデン - 4 - イル、1H - インデン - 5 - イル、1H - インデン - 6 - イル、1H - インデン - 7 - イル、2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル、2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 2 - イル、2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イルまたは 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 5 - イル、

40

を表し、

または

R^3 は、フラン - 2 - イル、フラン - 3 - イル、チオフェン - 2 - イル、チオフェン - 3 - イル、イソオキサゾール - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イル、イソオキサゾール - 5 - イル、1H - ピロール - 1 - イル、1H - ピロール - 2 - イル、1H - ピロール - 3 - イル、オキサゾール - 2 - イル、オキサゾール - 4 - イル、オキサゾール - 5 - イル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イル、チアゾール - 5 - イル、イソチアゾール - 3 - イル、イソチアゾール - 4 - イル、イソチアゾール - 5 - イル、ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イル、イミダゾール - 1 - イル、イミダゾール - 2 - イル、イミダゾール - 4 - イル、1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3

50

- イル、1，2，4 - オキサジアゾール - 5 - イル、1，3，4 - オキサジアゾール - 2 - イル、1，2，4 - チアジアゾール - 3 - イル、1，2，4 - チアジアゾール - 5 - イル、1，3，4 - チアジアゾール - 2 - イル、1，2，3 - トリアゾール - 1 - イル、1，2，3 - トリアゾール - 2 - イル、1，2，3 - トリアゾール - 4 - イル、1，2，4 - トリアゾール - 1 - イル、1，2，4 - トリアゾール - 3 - イル、ピリジン - 2 - イル、5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、ピリダジン - 3 - イル、ピリダジン - 4 - イル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イル、ピラジン - 2 - イル、1，3，5 - トリアジン - 2 - イルまたは1，2，4 - トリアジン - 3 - イル、

を表し、

または

R³は、1H - インドール - 1 - イル、1H - インドール - 2 - イル、1H - インドール - 3 - イル、1H - インドール - 4 - イル、1H - インドール - 5 - イル、1H - インドール - 6 - イル、1H - インドール - 7 - イル、1H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル、1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル、1H - ベンゾイミダゾール - 4 - イル、ベンゾイミダゾール - 5 - イル、1H - インダゾール - 1 - イル、1H - インダゾール - 3 - イル、1H - インダゾール - 4 - イル、1H - インダゾール - 5 - イル、1H - インダゾール - 6 - イル、1H - インダゾール - 7 - イル、2H - インダゾール - 2 - イル、1 - ベンゾフラン - 2 - イル、1 - ベンゾフラン - 3 - イル、1 - ベンゾフラン - 4 - イル、1 - ベンゾフラン - 5 - イル、1 - ベンゾフラン - 6 - イル、1 - ベンゾフラン - 7 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 2 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 3 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 4 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 5 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 6 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 7 - イル、キノリン - 2 - イル、キノリン - 3 - イル、キノリン - 4 - イル、キノリン - 5 - イル、キノリン - 6 - イル、キノリン - 7 - イル、キノリン - 8 - イル、イソキノリン - 1 - イル、イソキノリン - 3 - イル、イソキノリン - 4 - イル、イソキノリン - 5 - イル、イソキノリン - 6 - イル、イソキノリン - 7 - イルまたはイソキノリン - 8 - イル、

を表し、

または

R³は、ピロリジン - 2 - イル、ピロリジン - 3 - イル、モルホリン - 3 - イル、モルホリン - 2 - イル、ピペリジン - 2 - イル、ピペリジン - 3 - イルまたはピペラジン - 2 - イルを表し、

R⁶は、メチル、エチルまたはフェニルを表し、

R⁷は、水素、メチル、エチルまたはフェニルを表し、

または

L²が - C H = N - N (R⁷) - 基または - C (R⁶) = N - N (R⁷) - 基を表す場合、

2個の基R⁷およびR³は、L³を介してこれらが結合している窒素原子と一緒にになって、5員または6員の非置換の飽和ヘテロ環を形成する。)

化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩。

【請求項5】

請求項1から4の一項以上に記載の式(I)の化合物が植物病原性の有害な真菌および/またはこれらの生息地に施用されることを特徴とする、植物病原性の有害な真菌を防除するための方法。

【請求項6】

增量剤および/または界面活性剤に加えて、請求項1から4の一項以上に記載の式(I)の少なくとも1種の化合物を含むことを特徴とする、植物病原性の有害な真菌を防除するための組成物。

【請求項7】

植物病原性の有害な真菌を防除するための、請求項1から4の一項以上に記載の式(I)

10

20

30

40

50

) のチアゾリルオキシムエーテルおよびヒドラゾンの使用。

【請求項 8】

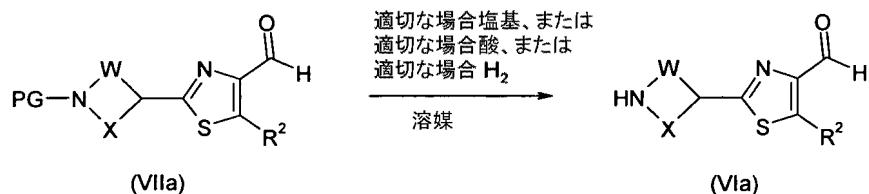
請求項 1 から 4 の一項以上に記載の式(Ⅰ)のチアゾリルオキシムエーテルおよびヒドラゾンが增量剤および/または界面活性剤と混合されることを特徴とする、植物病原性の有害な真菌を防除するための組成物を調製するための方法。

【請求項 9】

下記のステップ(a)から(g):

(a) 下記反応スキームに従い、適切な場合溶媒の存在下、および適切な場合酸の存在下または適切な場合塩基の存在下または適切な場合水素の供給源の存在下で、式(VI-1a)の化合物を式(VI-a)の化合物に変換するステップ

【化 2】



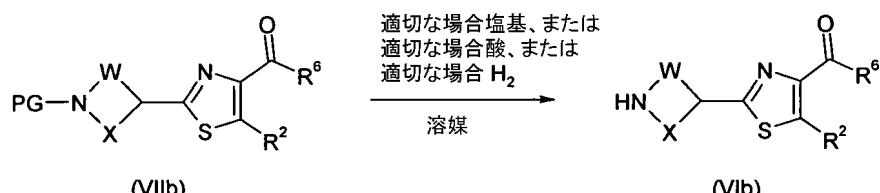
(式中、

P G = アセチル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、ベンジルまたはベンジルオキシカルボニルであり、

W、X、および R² は、請求項 1 に記載の式(Ⅰ)に関する定義した通りである。)

(b) 下記反応スキームに従い、適切な場合溶媒の存在下、および適切な場合酸の存在下または適切な場合塩基の存在下または適切な場合水素の供給源の存在下で、式(VI-1b)の化合物を式(VIb)の化合物に変換するステップ

【化 3】



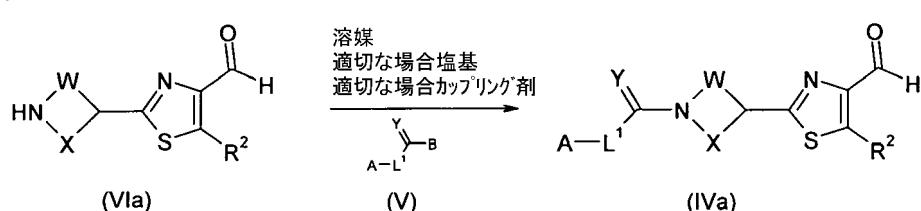
（式中、

P G = アセチル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、ベンジルまたはベンジルオキシカルボニルであり。

W、X、R⁶ および R² は、請求項 1 に記載の式 (I) に関する定義した通りである。)

(c) 下記反応スキームに従い、適切な場合カップリング剤、塩基および溶媒の存在下で、式(V)の化合物と式(VIa)の化合物との反応により式(IVa)の化合物を生成する反応。

主成 9 6



(式中、

B = O H、塩素、臭素またはヨウ素であり、

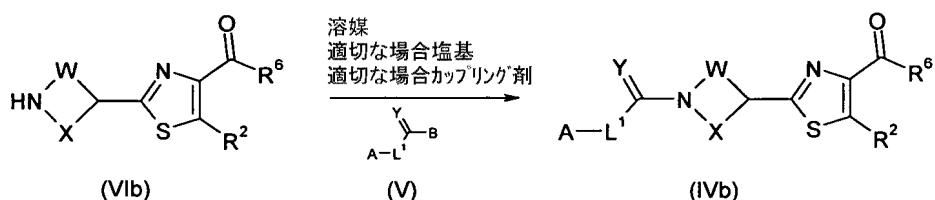
Y = 酸素であり、

A、W、X、L¹ および R² は、請求項 1 に記載の式(Ⅰ)に関して定義した通りである。

。) 、

(d) 下記反応スキームに従い、適切な場合カップリング剤、塩基および溶媒の存在下で、式(V)の化合物と式(IVb)の化合物との反応により式(IVb)の化合物を生成するステップ

【化 5】



10

(式中、

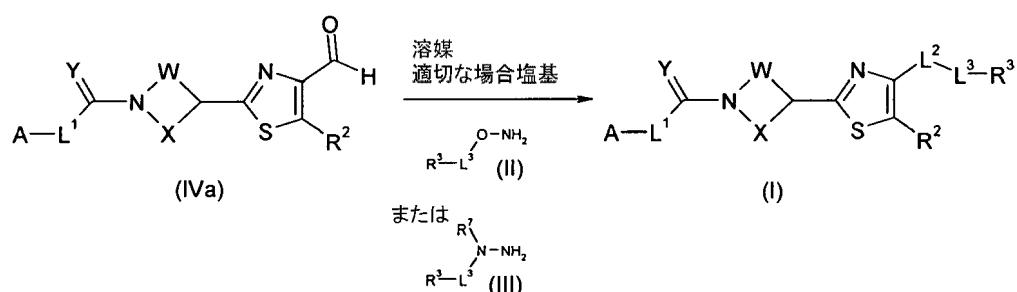
B = OH、塩素、臭素またはヨウ素であり、

Y = 酸素であり、

A、W、X、L¹、R⁶およびR²は、請求項1に記載の式(I)に関して定義した通りである。) 、

(e) 下記反応スキームに従い、適切な場合塩基および溶媒の存在下、式(II)または(III)の化合物と式(IVa)の化合物との反応により式(I)の化合物を生成するステップ

【化 6】



20

(式中、

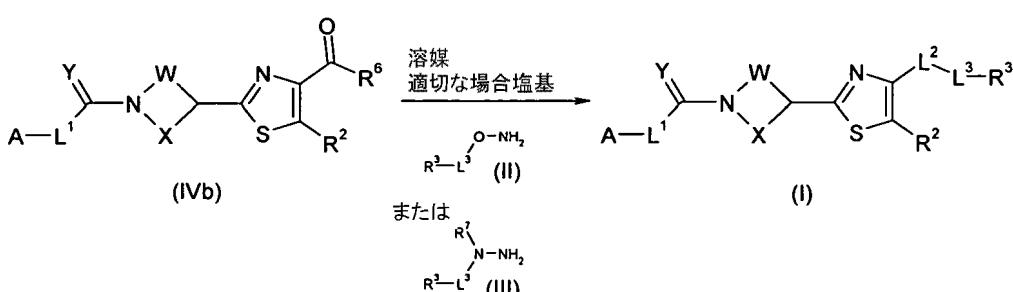
L²は、-CH=N-O-または-CH=N-N(R⁷)-を表し、

Y = 酸素であり、

A、W、X、L¹、L³、R²、R³およびR⁷は、請求項1に記載の式(I)に関して定義した通りである。) 、

(f) 下記反応スキームに従い、適切な場合塩基および溶媒の存在下で、式(II)または(III)の化合物と式(IVb)の化合物との反応により式(I)の化合物を生成するステップ

【化 7】



40

(式中、

L²は、-C(R⁶)=N-O-または-C(R⁶)=N-N(R⁷)-を表し、

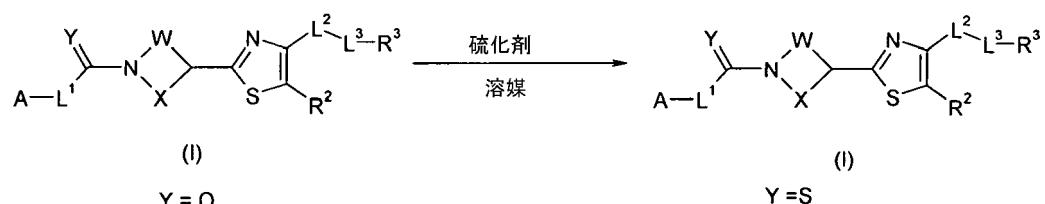
Y = 酸素であり、

A、W、X、L¹、L³、R²、R³、R⁶およびR⁷は、請求項1に記載の式(I)に関して定義した通りである。) 、

50

(g) 下記反応スキームに従い、硫化剤の存在下および適切な場合溶媒の存在下で、式(I)の化合物を式(I)の化合物に変換するステップ

【化 8】



10

(式中)

A、W、X、 L^1 、 L^2 、 L^3 、 R^2 および R^3 は、請求項 1 に記載の式(Ⅰ)に関して定義した通りである。)

の少なくとも1つを含む、式(Ⅰ)の化合物を調製するための方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

[0 0 0 1]

本発明は、チアゾリルオキシムエーテルおよびヒドラゾンならびにこれらの農芸化学的に活性な塩、これらの使用、ならびに植物中および／もしくは植物上または植物の種子中および／もしくは種子上の植物病原性の有害な真菌を防除するための方法および組成物、こうした組成物を調製し、種子を処理するための方法、ならびに農業、園芸および森林、動物の健康、材料の保護ならびに家庭および衛生分野における植物病原性の有害な真菌を防除するためのこれらの使用にも関する。本発明はさらに、チアゾリルオキシムエーテルおよびヒドラゾンを調製するための方法に関する。

20

【背景技术】

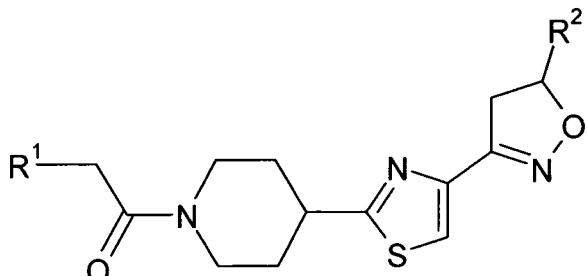
[0 0 0 2]

特定のヘテロシクリル置換チアゾールは、殺真菌性作物保護剤として用いることができる
ことが既に知られている。WO 07/014290およびWO 08/091594
は、アミド置換チアゾールを記載している。WO 08/091580は、アミン置換チ
アゾールを記載している。WO 08/013925およびWO 08/013622は
、ジヒドロイソオキサゾール置換チアゾールを記載している。

30

[0 0 0 3]

【化 1】



40

[0 0 0 4]

しかし、これらの化合物の殺真菌性活性は、特に低施用量において常に十分であるわけではない。

【先行技術文献】

【特許文献】

[0 0 0 5]

【特許文献1】国際公開第07/014290号

【特許文献2】国際公開第08/091594号

【特許文献3】国際公開第08/091580号

50

【特許文献4】国際公開第08/013925号

【特許文献5】国際公開第08/013622号

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0006】

例えば活性スペクトル、毒性、選択性、施用量、残渣の形成および有利な製造に関し、最新の作物保護剤に対して生態学的および経済的要求が絶えず増加し、さらに例えば耐性の問題があることから、新規な作物保護剤、特に、少なくとも一部の地域において公知の殺真菌剤を上回る利点を有する殺真菌剤の開発が絶えず必要とされている。

【課題を解決するための手段】

10

【0007】

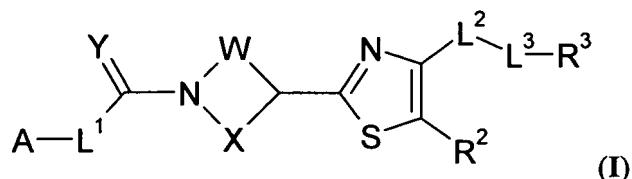
驚くべきことに、本チアゾリルオキシムエーテルおよびヒドラゾンが、記述した目的の少なくとも一部の側面を解決し、作物保護剤、特に殺真菌剤としての使用に適当であることがここで、見出された。

【0008】

本発明は、式(I)

【0009】

【化2】



20

(式中、記号は以下の意味を有する：

Aは、メチルを表し、

または

Aは、非置換または置換されたフェニルを表し、

ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

シアノ、ニトロ、ハロゲン、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₃-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₄-C₁₀-シクロアルキルアルキル、C₄-C₁₀-アルキルシクロアルキル、C₅-C₁₀-アルキルシクロアルキルアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、トリ(C₁-C₂-アルキル)シリル、ベンジル、フェニル、ヒドロキシル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ、OCH₂OCH₃、SH、C₁-C₄-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、CHO、COOH、(C₁-C₄-アルコキシ)カルボニル、CONR⁴R⁵、CR⁴=NOR⁵、(C₁-C₄-アルキル)カルボニル、(C₁-C₄-ハロアルキル)カルボニル、(C₁-C₄-アルキル)カルボニルオキシ、(C₁-C₄-アルキル)カルボニルチオ、C₁-C₄-アルキルスルフィニル、C₁-C₄-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₄-アルキルスルホニル、C₁-C₄-ハロアルキルスルホニル、NR⁴R⁵、NR⁴COR⁵、SF₅、SO₂NR⁴R⁵、C₂-C₄-アルコキシアルキルまたは1-メトキシシクロプロピル、

30

から選択され、

または

Aは、ベンゾ縮合していくにより非置換または置換された5員または6員のヘテロアリールを表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

炭素における置換基：

シアノ、ニトロ、ハロゲン、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₃-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル C₄-C₁₀-シクロアルキ

40

50

ルアルキル、 $C_4 - C_{10}$ - アルキルシクロアルキル、 $C_5 - C_{10}$ - アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、トリ($C_1 - C_2$ - アルキル)シリル、ベンジル、フェニル、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 OCH_2OCH_3 、 SH 、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ、 CHO 、 $COOH$ 、($C_1 - C_4$ - アルコキシ)カルボニル、 $CONR^4R^5$ 、 $CR^4 = NOR^5$ 、($C_1 - C_4$ - アルキル)カルボニル、($C_1 - C_4$ - ハロアルキル)カルボニル、($C_1 - C_4$ - アルキル)カルボニルオキシ、($C_1 - C_4$ - アルキル)カルボニルチオ、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルホニル、 NR^4R^5 、 NR^4COR^5 、 SF_5 、 $SO_2NR^4R^5$ 、 $C_2 - C_4$ - アルコキシアルキルまたは1 - メトキシシクロプロピル

窒素における置換基：

ヒドロキシル、 NR^4R^5 、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ - ハロシクロアルキル、 $C_4 - C_{10}$ - アルキルシクロアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニルまたは $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、

から選択され、

L^1 は、 $(C(R^1)_2)_n$ を表し、

ここで、 $n = 0$ から3であり、

R^1 は、同一であります異なり、互いに独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 - C_2$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキルまたはシアノを表し、

ただし、 L^1 が、最大でも4つの水素と異なる R^1 を含有することができるという条件であります、

Y は、硫黄または酸素を表し、

W は、非置換または一置換の C_1 - から C_3 - 炭素鎖を表し、ここで、置換基はオキソ、ヒドロキシル、シアノおよび $C_1 - C_4$ - アルキルからなる群から選択され、

X は、非置換または一置換の C_1 - から C_2 - 炭素鎖を表し、ここで、置換基はオキソ、ヒドロキシル、シアノおよび $C_1 - C_4$ - アルキルからなる群から選択され、

R^2 は、水素、 $C_1 - C_2$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキルまたはハロゲンを表し、

L^2 は、 $-CH = N - O -$ 、 $-C(R^6) = N - O -$ 、 $-CH = N - N(R^7) -$ または $-C(R^6) = N - N(R^7) -$ を表し、

L^3 は、直接結合を表し、

または

L^3 は、最大4個までの置換基を含有することができる C_1 - から C_4 - 炭素鎖を表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧から選択され、

ハロゲン、 $C_1 - C_2$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - アルコキシ、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキルまたは $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、

R^3 は、メチル、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキル、 $-CH = CH_2$ 、 $-C - CH$ 、または非置換もしくは一置換の $C_3 - C_{10}$ - シクロアルキルを表し、ここで、置換基は下記一覧：

シアノ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、トリ($C_1 - C_2$ - アルキル)シリル、フェニル、ヒドロキシル、オキソ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオまたは $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ、

から選択され、

または

10

20

30

40

50

R^3 は、非置換または置換されたフェニルを表し、

ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ - ハロシクロアルキル、 $C_4 - C_{10}$ - シクロアルキルアルキル、 $C_4 - C_{10}$ - ハロシクロアルキルアルキル、 $C_4 - C_{10}$ - アルキルシクロアルキル、 $C_5 - C_{10}$ - アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_4 - C_{10}$ - シクロアルコキシアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルケニル、 $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、 $C_2 - C_6$ - アルコキシアルキル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルコキシアルキル、 $C_3 - C_8$ - アルコキシアルコキシアルキル、トリ($C_1 - C_2$ - アルキル)シリル、ベンジル、フェニル、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_2 - C_6$ - アルコキシアルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニルオキシ、 $C_3 - C_6$ - シクロアルコキシ、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルオキシ、 $C_3 - C_6$ - ハロシクロアルコキシ、 $C_4 - C_{10}$ - シクロアルキルアルキルオキシ、 $NR^4 R^5$ 、 SH 、 SF_5 、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ、 $C_2 - C_6$ - アルキルアルキルチオ、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルチオ、 CHO 、 $COOH$ 、($C_1 - C_6$ - アルコキシ)カルボニル、 $CONR^4 R^5$ 、 $CR^4 = NOR^5$ 、($C_1 - C_6$ - アルキル)カルボニル、($C_1 - C_6$ - ハロアルキル)カルボニル、($C_1 - C_6$ - アルキル)カルボニルオキシ、($C_1 - C_6$ - ハロアルキル)カルボニルオキシ、($C_1 - C_6$ - アルキル)カルボニルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルホニル、 $NR^4 COR^5$ または $SO_2 NR^4 R^5$

から選択され、

または

R^3 は、飽和または部分的もしくは完全不飽和のナフチルまたはインデニルを表し、これは最大 2 個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

シアノ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、トリ($C_1 - C_2$ - アルキル)シリル、フェニル、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオまたは $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ、

から選択され、

または

R^3 は、非置換または置換された 5 員または 6 員のヘテロアリール基を表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

炭素における置換基：シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ - ハロシクロアルキル、 $C_4 - C_{10}$ - シクロアルキルアルキル、 $C_4 - C_{10}$ - アルキルシクロアルキル、 $C_5 - C_10$ - アルキルシクロアルキルアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、トリ($C_1 - C_2$ - アルキル)シリル、ベンジル、フェニル、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 OCH_2OCH_3 、 SH 、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ、 $COOH$ 、($C_1 - C_4$ - アルコキシ)カルボニル、 $CONR^6 R^7$ 、($C_1 - C_4$ - アルキル)カルボニル、($C_1 - C_4$ - ハロアルキル)カルボニル、($C_1 - C_4$ - アルキル)カルボニルオキシ、($C_1 - C_4$ - アルキル)カルボニルチオ、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルホニル、 $NR^4 R^5$ 、 $NR^4 R^5$

10

20

30

40

50

R^4COR^5 、 SF_5 、 $SO_2NR^4R^5$ 、 C_2-C_4 -アルコキシアルキルまたは1-メトキシシクロプロピル、

窒素における置換基：ヒドロキシル、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_3 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル、 C_4-C_{10} -アルキルシクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニルまたはフェニル、

から選択され、

または

R^3 は、最大2個までの置換基を含有することができるベンゾ縮合した非置換または置換された5員または6員のヘテロアリールを表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

炭素における置換基：シアノ、ニトロ、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_3 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル、 C_4-C_{10} -シクロアルキルアルキル、 C_4-C_{10} -アルキルシクロアルキル、 C_5-C_1 -アルキルシクロアルキルアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、トリ(C_1-C_2 -アルキル)シリル、ベンジル、フェニル、ヒドロキシル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 OCH_2OCH_3 、 SH 、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 $COOH$ 、(C_1-C_4 -アルコキシ)カルボニル、 $CONR^4R^5$ 、(C_1-C_4 -アルキル)カルボニル、(C_1-C_4 -ハロアルキル)カルボニル、(C_1-C_4 -アルキル)カルボニルオキシ、(C_1-C_4 -アルキル)カルボニルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、 NR^4R^5 、 NR^4COR^5 、 SF_5 、 $SO_2NR^4R^5$ 、 C_2-C_4 -アルコキシアルキルまたは1-メトキシシクロプロピル、

窒素における置換基： C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_3 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_3-C_6 -ハロシクロアルキル、 C_4-C_{10} -アルキルシクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニルまたはフェニル、

から選択され、

または

R^3 は、炭素原子を介して結合され、窒素、酸素および硫黄からなる群から選択される最大2個までのさらなるヘテロ原子を含有することができる非置換または一置換の5員から15員のヘテロシクリル基を表し、ここで、置換基は下記一覧：

炭素における置換基：シアノ、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_3 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、トリ(C_1-C_2 -アルキル)シリル、フェニル、ヒドロキシル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_2-C_6 -アルキニルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオまたは C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、

窒素における置換基： C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_3 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、トリ(C_1-C_2 -アルキル)シリルまたはフェニル、

から選択され、

R^4 、 R^5 は、互いに独立して、水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_3 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルまたはフェニルを表し、

R^6 は、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_3 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シクロアルキルまたはフェニルを表し、

R^7 は、水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_3 -ハロアルキル、 C_3-C_6 -シ

10

20

30

40

50

クロアルキルまたはフェニルを表し、
または

L^2 が $-CH=N-N(R^7)-$ 基または $-C(R^6)=N-N(R^7)-$ 基を表す場合、

2 個の基 R^7 および R^3 は、 L^3 を介してこれらが結合している窒素原子と一緒にになって、N、O および S からなる群から選択される最大 2 個までのさらなるヘテロ原子を含有することができる 5 員から 8 員の非置換または置換された飽和または部分飽和または不飽和のヘテロ環を形成し、ここで、2 個の酸素原子は隣接せず、

ここで、可能な置換基は、互いに独立して、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、ヒドロキシリルおよびハロゲンからなる群から選択される。) 10 の化合物、およびこれらの農芸化学的に活性な塩も提供する。

【0010】

本発明は、殺真菌剤としての式(I)の化合物の使用も提供する。

【0011】

本発明による式(I)のチアゾリルオキシムエーテルおよびヒドラゾン、ならびにこれらの農芸化学的に活性な塩も、植物病原性の有害な真菌を防除するのに非常に適当である。上述した本発明による化合物は特に強力な殺真菌性活性を有し、作物保護、家庭および衛生分野、ならびに材料の保護の両方で使用することができる。

【0012】

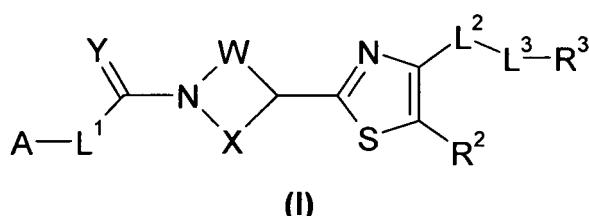
式(I)の化合物は、純粋な形態で、ならびに各種可能な異性体形態の混合物、特に E および Z、トレオおよびエリトロなどの立体異性体、ならびに R および S 異性体またはアトロブ異性体などの光学異性体、ならびに適切な場合互変異性体の混合物としての両方で存在することができる。特許請求するものは、E および Z 異性体の両方ならびにトレオおよびエリトロ、ならびにさらに光学異性体、これらの異性体の任意の混合物、ならびにさらに可能な互変異性形態である。特に、二重結合配置に依存して、置換基 L^2 において異なる異性体、すなわちシスもしくはトランス異性体または E もしくは Z 異性体があり得るので、式(I)の化合物は、純粋な異性体の形態、および任意の異性体混合物の形態の両方で生じる場合がある。本発明において、化合物(I)のシスおよびトランス異性体の異性体比は、1:99 から 99:1 で変動してよい。 20

【0013】

式(I)の化合物に存在するオキシムまたはヒドラゾン単位の構造単位には(E)および/または(Z)異性体が含まれ、これらの立体異性体は、本発明の対象物質の一部を形成する。 30

【0014】

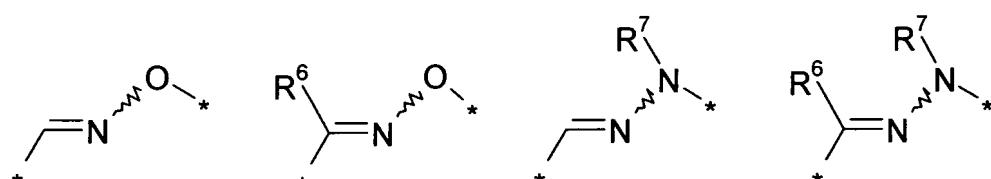
【化3】



(L^2 は、

【0015】

【化4】



10

20

30

40

50

を表す。)

【0016】

好みいのは、式(I)（式中、記号の1つ以上が下記意味：

Aは、メチルを表し、

または

Aは、最大2個までの置換基を含有することができるフェニルを表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧から選択され、

シアノ、ニトロ、ハロゲン、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₃-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₂-C₄-アルケニル、C₂-C₄-アルキニル、ヒドロキシリ、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₁-C₄-アルキルチオ、C₁-C₄-ハロアルキルチオ、(C₁-C₄-アルコキシ)カルボニル、(C₁-C₄-アルキル)カルボニル、(C₁-C₄-ハロアルキル)カルボニル、C₁-C₄-アルキルスルフィニル、C₁-C₄-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₄-アルキルスルホニルまたはC₁-C₄-ハロアルキルスルホニル、

または

Aは、下記の群から選択される複素芳香族基を表し、フラン-2-イル、フラン-3-イル、チオフェン-2-イル、チオフェン-3-イル、イソオキサゾール-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、イソオキサゾール-5-イル、1H-ピロール-1-イル、1H-ピロール-2-イル、1H-ピロール-3-イル、オキサゾール-2-イル、オキサゾール-4-イル、オキサゾール-5-イル、チアゾール-2-イル、チアゾール-4-イル、チアゾール-5-イル、イソチアゾール-3-イル、イソチアゾール-4-イル、イソチアゾール-5-イル、ピラゾール-1-イル、ピラゾール-3-イル、ピラゾール-4-イル、イミダゾール-1-イル、イミダゾール-2-イル、イミダゾール-4-イル、1,2,4-オキサジアゾール-3-イル、1,2,4-オキサジアゾール-5-イル、1,3,4-オキサジアゾール-2-イル、1,2,4-チアジアゾール-3-イル、1,2,4-チアジアゾール-5-イル、1,3,4-チアジアゾール-2-イル、1,2,3-トリアゾール-1-イル、1,2,3-トリアゾール-2-イル、1,2,3-トリアゾール-4-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、1,2,4-トリアゾール-3-イル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、ピリダジン-3-イル、ピリダジン-4-イル、ピリミジン-2-イル、ピリミジン-4-イル、ピリミジン-5-イル、ピラジン-2-イル、1,3,5-トリアジン-2-イル、1,2,4-トリアジン-3-イル、1H-インドール-1-イル、1H-インドール-2-イル、1H-インドール-3-イル、1H-インドール-4-イル、1H-インドール-5-イル、1H-インドール-6-イル、1H-インドール-7-イル、1H-ベンゾイミダゾール-1-イル、1H-ベンゾイミダゾール-2-イル、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル、ベンゾイミダゾール-5-イル、1H-インダゾール-1-イル、1H-インダゾール-3-イル、1H-インダゾール-4-イル、1H-インダゾール-5-イル、1H-インダゾール-6-イル、1H-インダゾール-7-イル、2H-インダゾール-2-イル、1-ベンゾフラン-2-イル、1-ベンゾフラン-3-イル、1-ベンゾフラン-4-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、1-ベンゾフラン-6-イル、1-ベンゾフラン-7-イル、1-ベンゾチオフェン-2-イル、1-ベンゾチオフェン-3-イル、1-ベンゾチオフェン-4-イル、1-ベンゾチオフェン-5-イル、1-ベンゾチオフェン-6-イル、1-ベンゾチオフェン-7-イル、1,3-ベンゾチアゾール-2-イル、キノリン-2-イル、キノリン-3-イル、キノリン-4-イル、キノリン-5-イル、キノリン-6-イル、キノリン-7-イル、キノリン-8-イル、イソキノリン-1-イル、イソキノリン-3-イル、イソキノリン-4-イル、イソキノリン-5-イル、イソキノリン-6-イル、イソキノリン-7-イルまたはイソキノリン-8-イル、

これは最大2個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

10

20

30

40

50

炭素における置換基：シアノ、ニトロ、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、ヒドロキシル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオまたはC₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、

窒素における置換基：C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、シクロプロピル、C₂ - C₄ - アルケニルまたはC₂ - C₄ - アルキニル、

から選択され、

L¹は、(C(R¹)₂)_nを表し、

ここで、n = 0 から 2 であり、

R¹は、同一でありまたは異なり、互いに独立して、水素、塩素、フッ素、メチル、CF₃またはシアノを表し、

ただし、L¹が、最大でも 2 つの水素と異なるR¹を含有することができるという条件であり、

Yは、硫黄または酸素を表し、

Wは、非置換または一置換のC₁ - から C₂ - 炭素鎖を表し、ここで、置換基はシアノおよびC₁ - C₂ - アルキルからなる群から選択され、

Xは、非置換または一置換のC₁ - から C₂ - 炭素鎖を表し、ここで、置換基はシアノおよびC₁ - C₂ - アルキルからなる群から選択され、

R²は、水素、C₁ - C₂ - アルキルまたはハロゲンを表し、

L²は、-CH=N-O-、-C(R⁶)=N-O-、-CH=N-N(R⁷)-または-C(R⁶)=N-N(R⁷)-を表し、

L³は、直接結合を表し、

または

L³は、最大 2 個までの置換基を含有することができるC₁ - から C₄ - 炭素鎖を表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₂ - アルコキシ、C₁ - C₂ - ハロアルキルまたはシクロプロピル、

から選択され、

R³は、非置換または一置換のC₃ - C₁₀ - シクロアルキルを表し、ここで、置換基は下記一覧：

ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、トリ(C₁ - C₂ - アルキル)シリル、フェニルまたはオキソ、

から選択され、

または

R³は、最大 3 個までの置換基を含有することができるフェニルを表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

シアノ、ニトロ、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、トリ(C₁ - C₂ - アルキル)シリル、フェニル、ヒドロキシル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオまたはC₁ - C₆ - ハロアルキルチオ、

から選択され、

または

R³は、ナフタレン-1-イル、ナフタレン-2-イル、1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル、1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-2-イル、5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-1-イル、5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-2-イル、デカリン-1-イル、デカリン-2-イル、1H-インデン-1-イル、1H-インデン-2-イル、1H-インデン-3-イル、1H-インデン-4-イル、1H-インデン-5-イル、1H-インデン-6-イル、1H-インデン-7-イル、2

, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル、2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 2 - イル、2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イルまたは2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 5 - イル、

を表し、

これらは最大 2 個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

シアノ、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、フェニル、ヒドロキシル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₃ - ハロアルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオまたはC₁ - C₃ - ハロアルキルチオ、

から選択され、

10

または

R³ は、フラン - 2 - イル、フラン - 3 - イル、チオフェン - 2 - イル、チオフェン - 3 - イル、イソオキサゾール - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イル、イソオキサゾール - 5 - イル、1 H - ピロール - 1 - イル、1 H - ピロール - 2 - イル、1 H - ピロール - 3 - イル、オキサゾール - 2 - イル、オキサゾール - 4 - イル、オキサゾール - 5 - イル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イル、チアゾール - 5 - イル、イソチアゾール - 3 - イル、イソチアゾール - 4 - イル、イソチアゾール - 5 - イル、ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イル、イミダゾール - 1 - イル、イミダゾール - 2 - イル、イミダゾール - 4 - イル、1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル、1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 5 - イル、1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 3 - イル、1 , 2 , 4 - チアジアゾール - 5 - イル、1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - イル、1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル、1 , 2 , 3 - トリアゾール - 2 - イル、1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル、1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル、1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、ピリダジン - 3 - イル、ピリダジン - 4 - イル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イル、ピラジン - 2 - イル、1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イルまたは1 , 2 , 4 - トリアジン - 3 - イル、

20

を表し、

これらは最大 2 個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

30

炭素における置換基：シアノ、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、フェニル、ヒドロキシル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオまたはC₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、

窒素における置換基：C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニルまたはフェニル、

から選択され、

または

R³ は、1 H - インドール - 1 - イル、1 H - インドール - 2 - イル、1 H - インドール - 3 - イル、1 H - インドール - 4 - イル、1 H - インドール - 5 - イル、1 H - インドール - 6 - イル、1 H - インドール - 7 - イル、1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル、1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル、1 H - ベンゾイミダゾール - 4 - イル、ベンゾイミダゾール - 5 - イル、1 H - インダゾール - 1 - イル、1 H - インダゾール - 3 - イル、1 H - インダゾール - 4 - イル、1 H - インダゾール - 5 - イル、1 H - インダゾール - 6 - イル、1 H - インダゾール - 7 - イル、2 H - インダゾール - 2 - イル、1 - ベンゾフラン - 2 - イル、1 - ベンゾフラン - 3 - イル、1 - ベンゾフラン - 4 - イル、1 - ベンゾフラン - 5 - イル、1 - ベンゾフラン - 6 - イル、1 - ベンゾフラン - 7 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 2 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 3 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 4 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 5 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 6 - イ

40

50

ル、1-ベンゾチオフェン-7-イル、キノリン-2-イル、キノリン-3-イル、キノリン-4-イル、キノリン-5-イル、キノリン-6-イル、キノリン-7-イル、キノリン-8-イル、イソキノリン-1-イル、イソキノリン-3-イル、イソキノリン-4-イル、イソキノリン-5-イル、イソキノリン-6-イル、イソキノリン-7-イルまたはイソキノリン-8-イル、

を表し、

これらは最大2個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

炭素における置換基：シアノ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_3$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、フェニル、ヒドロキシル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオまたは $C_1 - C_4$ -ハロアルキルチオ、

10

窒素における置換基： $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_3$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニルまたはフェニル、から選択され、

または

R^3 は、炭素原子を介して結合し、窒素、酸素および硫黄からなる群から選択される最大2個までのさらなるヘテロ原子を含有することができる非置換または一置換の5員から6員のヘテロシクリル基を表し、ここで、置換基は下記一覧：

炭素における置換基： $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_3$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、トリ($C_1 - C_2$ -アルキル)シリルまたはフェニル、

20

窒素における置換基： $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、トリ($C_1 - C_2$ -アルキル)シリルまたはフェニル、

から選択され、

R^6 は、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_2$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキルまたはフェニルを表し、

R^7 は、水素、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_2$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキルまたはフェニルを表し、

30

または

L^2 が $-CH=N-N(R^7)$ -基または $-C(R^6)=N-N(R^7)$ -基を表す場合、

2個の基 R^7 および R^3 は、 L^3 を介してこれらが結合している窒素原子と一緒にになって、N、OおよびSからなる群から選択される最大2個までのさらなるヘテロ原子を含有することができる5員から8員の非置換または置換された飽和または部分飽和または不飽和のヘテロ環を形成し、ここで、2個の酸素原子は隣接せず、

ここで、可能な置換基は互いに独立して、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、ヒドロキシルおよびハロゲンからなる群から選択される、

の1つを有する。)

40

の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0017】

特に好ましいのは、式(I)(式中、記号の1つ以上が下記意味：

Aは、メチルを表し、

または

Aは、最大2個までの置換基を含有することができるフェニルを表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 - C_2$ -アルキル、 $C_1 - C_2$ -ハロアルキル、ヒドロキシル、 $C_1 - C_2$ -アルコキシまたは $C_1 - C_2$ -ハロアルコキシ、

から選択され、

50

または

A は、下記の群から選択される複素芳香族基を表し、フラン - 2 - イル、フラン - 3 - イル、チオフェン - 2 - イル、チオフェン - 3 - イル、オキサゾール - 2 - イル、オキサゾール - 4 - イル、オキサゾール - 5 - イル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イル、チアゾール - 5 - イル；ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イル、イミダゾール - 1 - イル、イミダゾール - 2 - イル、イミダゾール - 4 - イル、1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イルまたはピリジン - 4 - イル、

これらは最大 2 個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

10

炭素における置換基：シアノ、ハロゲン、C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₂ - ハロアルキル、ヒドロキシル、C₁ - C₂ - アルコキシまたはC₁ - C₂ - ハロアルコキシ、

窒素における置換基：C₁ - C₂ - アルキルまたはC₁ - C₂ - ハロアルキル、

から選択され、

L¹ は、(C(R¹)₂)_n を表し、
ここで、n = 1 または 2 であり、

R¹ は、同一であります異なり、互いに独立して、水素またはメチルを表し、
ただし、L¹ が最大でも 2 個のメチル置換基を含有することができるという条件であり、

Y は、硫黄または酸素を表し、

W は、-CH₂CH₂- を表し、

X は、-CH₂CH₂- を表し、

R² は、水素、メチル、塩素または臭素を表し、

L² は、-CH=N-O-、-C(R⁶)=N-O-、-CH=N-N(R⁷)- または -C(R⁶)=N-N(R⁷)- を表し、

L³ は、直接結合を表し、

または

L³ は、最大 2 個までの置換基を含有することができる C₁ - から C₄ - 炭素鎖を表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

メチル、メトキシまたはCF₃、

から選択され、

20

R³ は、非置換または一置換のC₃ - C₁₀ - シクロアルキルを表し、ここで、置換基は下記の一覧：

フッ素、塩素、メチル、エチル、シクロプロピル、シクロペンチルまたはシクロヘキシル、

から選択され、

または

R³ は、最大 3 個までの置換基を含有することができるフェニルを表し、ここで、置換基は互いに独立して下記の一覧：

シアノ、ニトロ、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、フェニル、ヒドロキシル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオまたはC₁ - C₆ - ハロアルキルチオ、

から選択され、

または

R³ は、ナフタレン - 1 - イル、ナフタレン - 2 - イル、1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル、1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 2 - イル、5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル、5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 2 - イル、デカリニン - 1 - イル、デカリニン - 2 - イル、1H - インデン - 1 - イル、1H - インデン - 2 - イル、1H - インデン - 3 - イル、1H - インデン - 4 - イル、1H - インデン - 5 - イル、1H - インデン - 6 - イル、1H - インデン - 7 - イル、2 , 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル、2 , 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 2 -

40

50

イル、2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イルまたは2,3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イル、
を表し、

これらは最大2個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、CF₃、CHF₂、シクロプロピル、フェニル、ヒドロキシル、OMe、OEt、OCF₃、OC HF₂、OC₂F₅、SM_eまたはSCF₃、

から選択され、

または

R³は、フラン-2-イル、フラン-3-イル、チオフェン-2-イル、チオフェン-3-イル、イソオキサゾール-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、イソオキサゾール-5-イル、1H-ピロール-1-イル、1H-ピロール-2-イル、1H-ピロール-3-イル、オキサゾール-2-イル、オキサゾール-4-イル、オキサゾール-5-イル、チアゾール-2-イル、チアゾール-4-イル、チアゾール-5-イル、イソチアゾール-3-イル、イソチアゾール-4-イル、イソチアゾール-5-イル、ピラゾール-1-イル、ピラゾール-3-イル、ピラゾール-4-イル、イミダゾール-1-イル、イミダゾール-2-イル、イミダゾール-4-イル、1,2,4-オキサジアゾール-3-イル、1,2,4-オキサジアゾール-5-イル、1,2,4-チアジアゾール-3-イル、1,2,4-チアジアゾール-5-イル、1,3,4-チアジアゾール-2-イル、1,2,3-トリアゾール-1-イル、1,2,3-トリアゾール-2-イル、1,2,3-トリアゾール-4-イル、1,2,4-トリアゾール-3-イル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、ピリダジン-3-イル、ピリダジン-4-イル、ピリミジン-2-イル、ピリミジン-4-イル、ピリミジン-5-イル、ピラジン-2-イル、1,3,5-トリアジン-2-イルまたは1,2,4-トリアジン-3-イル、

を表し、

これらは最大2個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

炭素における置換基：シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、1-メチルエチル、1,1-ジメチルエチル、CF₃、CHF₂、C₂F₅、CCl₃、シクロプロピル、フェニル、ヒドロキシル、OMe、OEt、OisoPr、OCF₃、OC HF₂、OC₂F₅、SM_eまたはSCF₃、

窒素における置換基：メチル、エチル、1-メチルエチル、1,1-ジメチルエチル、シクロプロピルまたはフェニル、

から選択され、

または

R³は、1H-インドール-1-イル、1H-インドール-2-イル、1H-インドール-3-イル、1H-インドール-4-イル、1H-インドール-5-イル、1H-インドール-6-イル、1H-インドール-7-イル、1H-ベンゾイミダゾール-1-イル、1H-ベンゾイミダゾール-2-イル、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル、ベンゾイミダゾール-5-イル、1H-インダゾール-1-イル、1H-インダゾール-3-イル、1H-インダゾール-4-イル、1H-インダゾール-5-イル、1H-インダゾール-6-イル、1H-インダゾール-7-イル、2H-インダゾール-2-イル、1-ベンゾフラン-2-イル、1-ベンゾフラン-3-イル、1-ベンゾフラン-4-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、1-ベンゾフラン-6-イル、1-ベンゾフラン-7-イル、1-ベンゾチオフェン-2-イル、1-ベンゾチオフェン-3-イル、1-ベンゾチオフェン-4-イル、1-ベンゾチオフェン-5-イル、1-ベンゾチオフェン-6-イル、1-ベンゾチオフェン-7-イル、キノリン-2-イル、キノリン-3-イル、キノ

10

20

30

40

50

リン - 4 - イル、キノリン - 5 - イル、キノリン - 6 - イル、キノリン - 7 - イル、キノリン - 8 - イル、イソキノリン - 1 - イル、イソキノリン - 3 - イル、イソキノリン - 4 - イル、イソキノリン - 5 - イル、イソキノリン - 6 - イル、イソキノリン - 7 - イルまたはイソキノリン - 8 - イル、

を表し、

これらは最大 2 個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

炭素における置換基：シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、1 - メチルエチル、1 , 1 - ジメチルエチル、 CF_3 、 CHF_2 、 C_2F_5 、 CCl_3 、シクロプロピル、フェニル、ヒドロキシリル、 OMe 、 OEt 、 Oisopr 、 OCF_3 、 OCHF_2 、 OC_2F_5 、 SMc または SCF_3 、

窒素における置換基：メチル、エチル、1 - メチルエチル、1 , 1 - ジメチルエチル、シクロプロピルまたはフェニル、

から選択され、

または

R^3 は、非置換または一置換のピロリジン - 2 - イル、ピロリジン - 3 - イル、モルホリン - 3 - イル、モルホリン - 2 - イル、ピペリジン - 2 - イル、ピペリジン - 3 - イルまたはピペラジン - 2 - イルを表し、ここで、置換基は下記一覧：

炭素における置換基：メチル、エチル、 CF_3 、シクロプロピルまたはフェニル、

窒素における置換基：メチル、エチル、シクロプロピルまたはフェニル、

から選択され、

R^6 は、メチル、エチル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシリルまたはフェニルを表し、

R^7 は、水素、メチル、エチル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシリルまたはフェニルを表し、

または

L^2 が $- \text{CH} = \text{N} - \text{N}(R^7) -$ 基または $- \text{C}(R^6) = \text{N} - \text{N}(R^7) -$ 基を表す場合、

2 個の基 R^7 および R^3 は、 L^3 を介してこれらが結合している窒素原子と一緒にになって、5 員または 6 員の非置換または置換された飽和または部分飽和または不飽和のヘテロ環を形成し、

ここで、可能な置換基は互いに独立して、メチル、エチル、 CF_3 、塩素およびフッ素からなる群から選択される、

の 1 つを有する。)

の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0018】

非常に特に好ましいのは、式(I)（式中、記号の 1 つ以上が下記意味：

A は、メチルを表し、

または

A は、最大 2 個までの置換基を含有することができるフェニルを表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧から選択され、

シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、 CF_3 、 CHF_2 、 C_2F_5 、 CCl_3 、ヒドロキシリル、 OMe 、 OCF_3 、 OCHF_2 、 OC_2F_5 または OC_2F_5 、

または

A は、下記の群から選択される複素芳香族基を表し：ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イルまたはピリジン - 4 - イル、

これらは最大 2 個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

10

20

30

40

50

炭素における置換基：シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、 $C F_3$ 、 $C H F_2$ 、 $C_2 F_5$ 、 $C C l_3$ 、ヒドロキシル、 $O M e$ 、 $O C F_3$ 、 $O C H F_2$ 、 $O C H_2 C F_3$ または $O C_2 F_5$ 、

窒素における置換基：メチル、エチルまたは $C F_3$ 、
から選択され、

L^1 は、 $(C(R^1)_2)_n$ を表し、

ここで、 $n = 1$ または 2 であり、

R^1 は、同一でありまたは異なり、互いに独立して水素、またはメチルを表し、
ただし、 L^1 が最大でも 1 個のメチル置換基を含有することができるという条件であり、

Y は、硫黄または酸素を表し、

W は、 $-C H_2 C H_2 -$ を表し、

X は、 $-C H_2 C H_2 -$ を表し、

R^2 は、水素またはメチルを表し、

L^2 は、 $-C H = N - O -$ 、 $-C(R^6) = N - O -$ 、 $-C H = N - N(R^7) -$ または $-C(R^6) = N - N(R^7) -$ を表し、

L^3 は、直接結合を表し、

または

L^3 は、最大 2 個までのメチル置換基を含有することができる $C_1 -$ から $C_2 -$ 炭素鎖を表し、

R^3 は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチルまたはシクロオクチルを表し、

または

R^3 は、最大 2 個までの置換基を含有することができるフェニルを表し、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、1-メチルエチル、1,1-ジメチルエチル、 $C F_3$ 、 $C H F_2$ 、 $C_2 F_5$ 、 $C C l_3$ 、フェニル、ヒドロキシル、 $O M e$ 、 $O E t$ 、 $O i s o P r$ 、 $O C F_3$ 、 $O C H F_2$ 、 $O C_2 F_5$ 、 $S M e$ または $S C F_3$ 、

から選択され、

または

R^3 は、ナフタレン-1-イル、ナフタレン-2-イル、1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル、1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-2-イル、5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-1-イル、5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-2-イル、デカリニ-1-イル、デカリニ-2-イル、1H-インデン-1-イル、1H-インデン-2-イル、1H-インデン-3-イル、1H-インデン-4-イル、1H-インデン-5-イル、1H-インデン-6-イル、1H-インデン-7-イル、2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル、2,3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イル、2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イルまたは2,3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イル、

を表し、

または

R^3 は、フラン-2-イル、フラン-3-イル、チオフェン-2-イル、チオフェン-3-イル、イソオキサゾール-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、イソオキサゾール-5-イル、1H-ピロール-1-イル、1H-ピロール-2-イル、1H-ピロール-3-イル、オキサゾール-2-イル、オキサゾール-4-イル、オキサゾール-5-イル、チアゾール-2-イル、チアゾール-4-イル、チアゾール-5-イル、イソチアゾール-3-イル、イソチアゾール-4-イル、イソチアゾール-5-イル、ピラゾール-1-イル、ピラゾール-3-イル、ピラゾール-4-イル、イミダゾール-1-イル、イミダゾール-2-イル、イミダゾール-4-イル、1,2,4-オキサジアゾール-3-イル、1,2,4-オキサジアゾール-5-イル、1,3,4-オキサジアゾール-2

10

20

30

40

50

- イル、1 , 2 , 4 - チアジアゾール - 3 - イル、1 , 2 , 4 - チアジアゾール - 5 - イル、1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - イル、1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル、1 , 2 , 3 - トリアゾール - 2 - イル、1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル、1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル、1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - イル、ピリジン - 2 - イル、5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、ピリダジン - 3 - イル、ピリダジン - 4 - イル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イル、ピラジン - 2 - イル、1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イルまたは1 , 2 , 4 - トリアジン - 3 - イル、

を表し、

または

R³は、1H - インドール - 1 - イル、1H - インドール - 2 - イル、1H - インドール - 3 - イル、1H - インドール - 4 - イル、1H - インドール - 5 - イル、1H - インドール - 6 - イル、1H - インドール - 7 - イル、1H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル、1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル、1H - ベンゾイミダゾール - 4 - イル、ベンゾイミダゾール - 5 - イル、1H - インダゾール - 1 - イル、1H - インダゾール - 3 - イル、1H - インダゾール - 4 - イル、1H - インダゾール - 5 - イル、1H - インダゾール - 6 - イル、1H - インダゾール - 7 - イル、2H - インダゾール - 2 - イル、1 - ベンゾフラン - 2 - イル、1 - ベンゾフラン - 3 - イル、1 - ベンゾフラン - 4 - イル、1 - ベンゾフラン - 5 - イル、1 - ベンゾフラン - 6 - イル、1 - ベンゾフラン - 7 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 2 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 3 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 4 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 5 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 6 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 7 - イル、キノリン - 2 - イル、キノリン - 3 - イル、キノリン - 4 - イル、キノリン - 5 - イル、キノリン - 6 - イル、キノリン - 7 - イル、キノリン - 8 - イル、イソキノリン - 1 - イル、イソキノリン - 3 - イル、イソキノリン - 4 - イル、イソキノリン - 5 - イル、イソキノリン - 6 - イル、イソキノリン - 7 - イルまたはイソキノリン - 8 - イル、

を表し、

または

R³は、ピロリジン - 2 - イル、ピロリジン - 3 - イル、モルホリン - 3 - イル、モルホリン - 2 - イル、ピペリジン - 2 - イル、ピペリジン - 3 - イルまたはピペラジン - 2 - イルを表し、

R⁶は、メチル、エチルまたはフェニルを表し、

R⁷は、水素、メチル、エチルまたはフェニルを表し、

または

L²が - C H = N - N (R⁷) - 基または - C (R⁶) = N - N (R⁷) - 基を表す場合、

2個の基R⁷およびR³は、L³を介してこれらが結合している窒素原子と一緒にになって、5員または6員の非置換の飽和ヘテロ環を形成する、

の1つを有する。)

の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0019】

特に好ましいのは、式(I)(式中、記号の1つ以上が下記意味:

Aは、5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イルを表し、

L¹は、- C H₂ - を表し、

Yは、酸素を表し、

Wは、- C H₂ C H₂ - を表し、

Xは、- C H₂ C H₂ - を表し、

R²は、水素を表し、

L²は、- C H = N - O - 、- C (C H₃) = N - O - 、- C H = N - N (C H₃)

10

20

30

40

50

- または - C H = N - N (C₆ H₅) - を表し、
L³ は、直接結合を表し、

または

L³ は、 - C H₂ - 、 - C H C H₃ - を表し、

R³ は、フェニル、2-メチルフェニル、4-クロロフェニル、2-フルオロフェニル、ピリジン-2-イルまたは5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イルを表し、
または

L² が - C H = N - N (R⁷) - 基または - C (R⁶) = N - N (R⁷) - 基を表す場合、

2個の基 R⁷ および R³ は、 L³ を介してこれらが結合している窒素原子と一緒にになって
、ピペリジン-1-イル基を形成する、

の1つを有する。)

の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0020】

さらに、特に好ましいのは、式(I)(式中、

A は、非置換または置換されたピラゾール-1-イルまたはピラゾール-4-イルを表し、

これらは最大2個までの置換基を含有することができ、ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

炭素における置換基：シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、C F₃、
C H F₂、C₂ F₅、C C l₃、ヒドロキシル、OMe、OCF₃、OCH F₂、OCH₂ CF₃ またはOC₂ F₅、

窒素における置換基：メチル、エチルまたはCF₃、

から選択され、

L¹ は、 - C H₂ - を表し、

ここで、他の置換基は、1つ以上の上述した意味を有する。)

の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0021】

さらに、特に好ましいのは、式(I)(式中、

A は、非置換または置換されたフェニルを表し、

ここで、置換基は互いに独立して下記一覧：

シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、C F₃、C H F₂、C₂ F₅、
C C l₃、ヒドロキシル、OMe、OCF₃、OCH F₂、OCH₂ CF₃ またはOC₂ F₅、

から選択され、

L¹ は、 - C H₂ - を表し、

ここで、他の置換基は、1つ以上の上述した意味を有する。)

の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0022】

さらに、特に好ましいのは、式(I)(式中、記号の1つ以上が下記意味：

A は、3,5-ビス(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル、3,5-ジエチル-1H-ピラゾール-1-イル、5-エチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル、3-tert-ブチル-5-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル、5-tert-ブチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル、3-tert-ブチル-5-(ペンタフルオロエチル)-1H-ピラゾール-1-イル、5-tert-ブチル-3-(ペンタフルオロエチル)-1H-ピラゾール-1-イル、3-(プロパン-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル、2,5-ジクロロフェニル、

を表す、の1つを有し、

ここで、他の置換基は、1つ以上の上述した意味を有する。)

10

20

30

40

50

の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0023】

さらに、特に好ましいのは、式(I)（式中、記号の1つ以上が下記意味：

L^3 は、 $CH_3CH_2CH_2CH_2$ を表す、

の1つを有し、

ここで、他の置換基は、1つ以上の上述した意味を有する。）

の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0024】

さらに、特に好ましいのは、式(I)（式中、記号の1つ以上が下記意味：

R^3 は、メチル、2-クロロフェニル、シクロヘキシリ、2,6-ジフルオロフェニル、2-ブロモフェニルを表す、

の1つを有し、

ここで、他の置換基は、1つ以上の上述した意味を有する。）

の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0025】

さらに、特に好ましいのは、式(I)（式中、記号の1つ以上が下記意味：

W は、 $-CH_2CH_2-$ を表し、

X は、 $-CH_2CH_2-$ を表し、

の1つを有し、

ここで、他の置換基は、1つ以上の上述した意味を有する。）

の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0026】

さらに、特に好ましいのは、式(I)（式中、記号の1つ以上が下記意味：

Y は、酸素を表し、

の1つを有し、

ここで、他の置換基は、1つ以上の上述した意味を有する。）

の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0027】

さらに、特に好ましいのは、式(I)（式中、

R^2 は、水素を表し、

ここで、他の置換基は、1つ以上の上述した意味を有する。）

の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0028】

さらに、特に好ましいのは、式(I)（式中、

L^2 は、 $-CH=N-O-$ を表し、

ここで、他の置換基は、1つ以上の上述した意味を有する。）

の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0029】

さらに、特に好ましいのは、式(I)（式中、

L^2 は、 $-C(Me)=N-O-$ を表し、

ここで、他の置換基は、1つ以上の上述した意味を有する。）

の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0030】

さらに、特に好ましいのは、下式(I)（式中、

L^2 は、 $-C(H)=N-N(Ph)-$ を表し、

ここで、他の置換基は、1つ以上の上述した意味を有する。）

の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0031】

さらに、特に好ましいのは、下式(I)（式中、

L^2 は、 $-C(H)=N-N(Me)-$ を表し、

10

20

30

40

50

ここで、他の置換基は、1つ以上の上述した意味を有する。)の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0032】

さらに、特に好ましいのは、下式(I)(式中、
 L^3 は、直接結合を表し、

ここで、他の置換基は、1つ以上の上述した意味を有する。)の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0033】

さらに、特に好ましいのは、下式(I)(式中、
 L^3 は、-CH₂-を表し、

ここで、他の置換基は、1つ以上の上述した意味を有する。)の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0034】

さらに、特に好ましいのは、下式(I)(式中、
 L^3 は、-CHCH₃-を表し、

ここで、他の置換基は、1つ以上の上述した意味を有する。)の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0035】

さらに、特に好ましいのは、下式(I)(式中、
 R^3 は、非置換のナフタレン-1-イルまたはナフタレン-2-イルを表し、
ここで、他の置換基は、1つ以上の上述した意味を有する。)
の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0036】

さらに、特に好ましいのは、下式(I)(式中、
 R^3 は、非置換フェニルを表し、
ここで、他の置換基は、1つ以上の上述した意味を有する。)
の化合物、およびさらにこれらの農芸化学的に活性な塩である。

【0037】

上記で示されている基の定義は、所望の通りに互いに組み合わせることができる。さらに、個々の定義が当てはまらない場合がある。

【0038】

上記で定義されている置換基の性質に依存して、式(I)の化合物は酸性または塩基性的特性を有し、塩、適切な場合内塩も、または無機酸もしくは有機酸との付加物、または塩基との付加物、または金属イオンとの付加物を形成することができる。式(I)の化合物が、塩基特性を誘起するアミノ基、アルキルアミノ基または他の基を保有する場合、これらの化合物は酸と反応して塩を生成することができ、または合成において塩として直接得ることができる。式(I)の化合物が、酸特性を誘起するヒドロキシル基、カルボキシル基または他の基を保有する場合、これらの化合物は塩基と反応して塩を生成することができる。適当な塩基は、例えば、アルカリ金属およびアルカリ土類金属の水酸化物、炭酸塩、重炭酸塩であり、特にナトリウム、カリウム、マグネシウムおよびカルシウム、さらにアンモニア、(C₁-C₄)-アルキル基を有する第1級、第2級および第3級アミン、(C₁-C₄)-アルカノールのモノ-、ジ-およびトリアルカノールアミン、コリンおよびクロロコリンのものである。

【0039】

この方法で得ることが可能な塩も、殺真菌性、除草性および殺虫性の特性を有する。

【0040】

無機酸の例は、フッ化水素、塩化水素、臭化水素およびヨウ化水素などのハロゲン化水素酸、硫酸、リン酸および硝酸、ならびにNaHSO₄およびKHSO₄などの酸性塩である。適当な有機酸は、例えば、ギ酸、炭酸、ならびに酢酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸およびプロピオン酸などのアルカン酸、ならびにさらにグリコール酸、チオシア

10

20

30

40

50

ン酸、乳酸、コハク酸、クエン酸、安息香酸、桂皮酸、シユウ酸、アルキルスルホン酸（1個から20個の炭素原子の直鎖または分枝のアルキル基を有するスルホン酸）、アリールスルホン酸またはアリールジスルホン酸（1個または2個のスルホン酸基を保有する、フェニルおよびナフチルなどの芳香族基）、アルキルホスホン酸（1個から20個の炭素原子の直鎖または分枝のアルキル基を有するホスホン酸）、アリールホスホン酸またはアリールジホスホン酸（1個または2個のホスホン酸基を保有する、フェニルおよびナフチルなどの芳香族基）であり、ここで、アルキル基およびアリール基は、さらなる置換基、例えば、p-トルエンスルホン酸、サリチル酸、p-アミノサリチル酸、2-フェノキシ安息香酸、2-アセトキシ安息香酸などを保有することができる。

【0041】

10

適当な金属イオンは、第2主族の元素、特にカルシウムおよびマグネシウム、第3および第4主族の元素、特にアルミニウム、スズおよび鉛、ならびにさらに第1から第8遷移族の元素、特にクロミウム、マンガン、鉄、コバルト、ニッケル、銅、亜鉛および他のイオンである。第4周期の元素の金属イオンが特に好ましい。本発明において、該金属は、とり得る様々な価数で存在することができる。

【0042】

任意に置換されている基は、一置換または多置換されていてよく、ここで、多置換の場合、置換基は同一でありまたは異なっていてよい。

【0043】

20

上記式に示されている記号の定義において、以下の置換基に関して一般に代表的である総称を使用した。

【0044】

30

ハロゲン：フッ素、塩素、臭素およびヨウ素、

アルキル：1個から8個の炭素原子を有する飽和の直鎖または分枝の炭化水素基、例えば、（これらに限定されないが）メチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル、1,1-ジメチルエチル、ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2,2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、ヘキシリ、1,1-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピルおよび1-エチル-2-メチルプロピル；などのC₁-C₆-アルキル、

30

アルケニル：2個から8個の炭素原子および任意の位置における二重結合を有する不飽和の直鎖または分枝の炭化水素基、例えば、（これらに限定されないが）エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチルエテニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-1-ブテニル、2-メチル-1-ブテニル、3-メチル-1-ブテニル、1-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1,1-ジメチル-2-プロペニル、1,2-ジメチル-1-ブロペニル、1,2-ジメチル-2-ブロペニル、1-エチル-1-ブロペニル、1-エチル-2-ブロペニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-1-ペンテニル、2-メチル-1-ペンテニル、3-メチル-1-ペンテニル、4-メチル-1-ペンテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-

40

50

ペンテニル、3 - メチル - 4 - ペンテニル、4 - メチル - 4 - ペンテニル、1 , 1 - ジメチル - 2 - ブテニル、1 , 1 - ジメチル - 3 - ブテニル、1 , 2 - ジメチル - 1 - ブテニル、1 , 2 - ジメチル - 2 - ブテニル、1 , 2 - ジメチル - 3 - ブテニル、1 , 3 - ジメチル - 1 - ブテニル、1 , 3 - ジメチル - 2 - ブテニル、1 , 3 - ジメチル - 2 - ブテニル、1 , 3 - ジメチル - 3 - ブテニル、2 , 2 - ジメチル - 3 - ブテニル、2 , 3 - ジメチル - 1 - ブテニル、2 , 3 - ジメチル - 2 - ブテニル、2 , 3 - ジメチル - 3 - ブテニル、3 , 3 - ジメチル - 1 - ブテニル、3 , 3 - ジメチル - 2 - ブテニル、1 - エチル - 1 - ブテニル、1 - エチル - 2 - ブテニル、1 - エチル - 3 - ブテニル、2 - エチル - 1 - ブテニル、2 - エチル - 2 - ブテニル、2 - エチル - 3 - ブテニル、1 , 1 , 2 - トリメチル - 2 - プロペニル、1 - エチル - 1 - メチル - 2 - プロペニル、1 - エチル - 2 - メチル - 2 - プロペニル；

などの C₂ - C₆ - アルケニル、

アルキニル：2 個から 8 個の炭素原子および任意の位置における三重結合を有する直鎖または分枝の炭化水素基、例えば、(これらに限定されないが)エチニル、1 - プロピニル、2 - プロピニル、1 - ブチニル、2 - ブチニル、3 - ブチニル、1 - メチル - 2 - プロピニル、1 - ペンチニル、2 - ペンチニル、3 - ペンチニル、4 - ペンチニル、1 - メチル - 2 - ブチニル、1 - メチル - 3 - ブチニル、2 - メチル - 3 - ブチニル、3 - メチル - 1 - ブチニル、1 , 1 - ジメチル - 2 - プロピニル、1 - エチル - 2 - プロピニル、1 - ヘキシニル、2 - ヘキシニル、3 - ヘキシニル、4 - ヘキシニル、5 - ヘキシニル、1 - メチル - 2 - ペンチニル、1 - メチル - 3 - ペンチニル、1 - メチル - 4 - ペンチニル、2 - メチル - 3 - ペンチニル、2 - メチル - 4 - ペンチニル、3 - メチル - 1 - ペンチニル、3 - メチル - 4 - ペンチニル、4 - メチル - 1 - ペンチニル、4 - メチル - 2 - ペンチニル、1 , 1 - ジメチル - 2 - ブチニル、1 , 1 - ジメチル - 3 - ブチニル、1 , 2 - ジメチル - 3 - ブチニル、2 , 2 - ジメチル - 3 - ブチニル、3 , 3 - ジメチル - 1 - ブチニル、1 - エチル - 2 - ブチニル、1 - エチル - 3 - ブチニル、2 - エチル - 3 - ブチニルおよび1 - エチル - 1 - メチル - 2 - プロピニル；

などの C₂ - C₆ - アルキニル、

アルコキシ：1 個から 8 個の炭素原子を有する飽和の直鎖または分枝のアルコキシ基、例えば、(これらに限定されないが)メトキシ、エトキシ、プロポキシ、1 - メチルエトキシ、ブトキシ、1 - メチルプロポキシ、2 - メチルプロポキシ、1 , 1 - ジメチルエトキシ、ペントキシ、1 - メチルブトキシ、2 - メチルブトキシ、3 - メチルブトキシ、2 , 2 - ジメチルプロポキシ、1 - エチルプロポキシ、ヘキソキシ、1 , 1 - ジメチルプロポキシ、1 , 2 - ジメチルプロポキシ、1 - メチルペントキシ、2 - メチルペントキシ、3 - メチルペントキシ、4 - メチルペントキシ、1 , 1 - ジメチルブトキシ、1 , 2 - ジメチルブトキシ、1 , 3 - ジメチルブトキシ、2 , 2 - ジメチルブトキシ、2 , 3 - ジメチルブトキシ、3 , 3 - ジメチルブトキシ、1 - エチルブトキシ、2 - エチルブトキシ、1 , 1 , 2 - トリメチルプロポキシ、1 , 2 , 2 - トリメチルプロポキシ、1 - エチル - 1 - メチルプロポキシおよび1 - エチル - 2 - メチルプロポキシ；

などの C₁ - C₆ - アルコキシ、

アルキルチオ：1 個から 8 個の炭素原子を有する飽和の直鎖または分枝のアルキルチオ基、例えば、(これらに限定されないが)メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、1 - メチルエチルチオ、ブチルチオ、1 - メチルプロピルチオ、2 - メチルプロピルチオ、1 , 1 - ジメチルエチルチオ、ペンチルチオ、1 - メチルブチルチオ、2 - メチルブチルチオ、3 - メチルブチルチオ、2 , 2 - ジメチルプロピルチオ、1 - エチルプロピルチオ、ヘキシリチオ、1 , 1 - ジメチルプロピルチオ、1 , 2 - ジメチルプロピルチオ、1 - メチルペンチルチオ、2 - メチルペンチルチオ、3 - メチルペンチルチオ、4 - メチルペンチルチオ、1 , 1 - ジメチルブチルチオ、1 , 2 - ジメチルブチルチオ、1 , 3 - ジメチルブチルチオ、2 , 2 - ジメチルブチルチオ、2 , 3 - ジメチルブチルチオ、3 , 3 - ジメチルブチルチオ、1 - エチルブチルチオ、2 - エチルブチルチオ、1 , 1 , 2 - トリメチルプロピルチオ、1 , 2 , 2 - トリメチルプロピルチオ、1 - エチル - 1 - メチルブ

10

20

30

40

50

ロピルチオおよび1 - エチル - 2 - メチルプロピルチオ；
などのC₁ - C₆ - アルキルチオ、

アルコキシカルボニル：カルボニル基(-CO-)を介して該骨格に結合している(上述した通りの)1個から6個の炭素原子を有するアルコキシ基、

アルキルスルフィニル：1個から8個の炭素原子を有する飽和の直鎖または分枝のアルキルスルフィニル基、例えば、(これらに限定されないが)メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、1 - メチルエチルスルフィニル、ブチルスルフィニル、1 - メチルプロピルスルフィニル、2 - メチルプロピルスルフィニル、1 , 1 - ジメチルエチルスルフィニル、ペンチルスルフィニル、1 - メチルブチルスルフィニル、2 - メチルブチルスルフィニル、3 - メチルブチルスルフィニル、2 , 2 - ジメチルプロピルスルフィニル、1 - エチルプロピルスルフィニル、ヘキシルスルフィニル、1 , 1 - ジメチルプロピルスルフィニル、1 , 2 - ジメチルプロピルスルフィニル、1 - メチルペンチルスルフィニル、2 - メチルペンチルスルフィニル、3 - メチルペンチルスルフィニル、4 - メチルペンチルスルフィニル、1 , 1 - ジメチルブチルスルフィニル、1 , 2 - ジメチルブチルスルフィニル、1 , 3 - ジメチルブチルスルフィニル、2 , 2 - ジメチルブチルスルフィニル、2 , 3 - ジメチルブチルスルフィニル、3 , 3 - ジメチルブチルスルフィニル、1 - エチルブチルスルフィニル、2 - エチルブチルスルフィニル、1 , 1 , 2 - トリメチルプロピルスルフィニル、1 , 2 , 2 - トリメチルプロピルスルフィニル、1 - エチル - 1 - メチルプロピルスルフィニルおよび1 - エチル - 2 - メチルプロピルスルフィニル；

などのC₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、

アルキルスルホニル：1個から8個の炭素原子を有する飽和の直鎖または分枝のアルキルスルホニル基、例えば、(これらに限定されないが)メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、1 - メチルエチルスルホニル、ブチルスルホニル、1 - メチルプロピルスルホニル、2 - メチルプロピルスルホニル、1 , 1 - ジメチルエチルスルホニル、ペンチルスルホニル、1 - メチルブチルスルホニル、2 - メチルブチルスルホニル、3 - メチルブチルスルホニル、2 , 2 - ジメチルプロピルスルホニル、1 - エチルプロピルスルホニル、ヘキシルスルホニル、1 , 1 - ジメチルプロピルスルホニル、1 , 2 - ジメチルプロピルスルホニル、1 - メチルペンチルスルホニル、2 - メチルペンチルスルホニル、3 - メチルペンチルスルホニル、4 - メチルペンチルスルホニル、1 , 1 - ジメチルブチルスルホニル、1 , 2 - ジメチルブチルスルホニル、1 , 3 - ジメチルブチルスルホニル、2 , 2 - ジメチルブチルスルホニル、2 , 3 - ジメチルブチルスルホニル、3 , 3 - ジメチルブチルスルホニル、1 - エチルブチルスルホニル、2 - エチルブチルスルホニル、1 , 1 , 2 - トリメチルプロピルスルホニル、1 , 2 , 2 - トリメチルプロピルスルホニル、1 - エチル - 1 - メチルプロピルスルホニルおよび1 - エチル - 2 - メチルプロピルスルホニル；

などのC₁ - C₆ - アルキルスルホニル、

シクロアルキル：3個から10個の炭素環員を有する単環式飽和炭化水素基、例えば、(これらに限定されないが)シクロプロピル、シクロペンチルおよびシクロヘキシル、

ハロアルキル：(上述した通りの)1個から8個の炭素原子を有する直鎖または分枝のアルキル基、ここで、これらの基において、水素原子の一部または全部は上述した通りのハロゲン原子によって置き換えられていてよく、例えば、(これらに限定されないが)クロロ - メチル、ブロモメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、1 - クロロエチル、1 - ブロモエチル、1 - フルオロエチル、2 - フルオロエチル、2 , 2 - ジフルオロエチル、2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル、2 - クロロ - 2 - フルオロエチル、2 - クロロ - 2 , 2 - ジフルオロエチル、2 , 2 - ジクロロ - 2 - フルオロエチル、2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル、ペントフルオロエチルおよび1 , 1 , 1 - トリフルオロプロパ - 2 - イルなどのC₁ - C₃ - ハロアルキル、

ハロアルコキシ：(上述した通り)1個から8個の炭素原子を有する直鎖または分枝

10

20

30

40

50

のアルコキシ基、ここで、これらの基において、水素原子の一部または全部は上述した通りのハロゲン原子によって置き換えられていてよく、例えば、(これらに限定されないが)、クロロメトキシ、ブロモメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、1 - クロロエトキシ、1 - ブロモエトキシ、1 - フルオロエトキシ、2 - フルオロエトキシ、2 , 2 - ジフルオロエトキシ、2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ、2 - クロロ - 2 - フルオロエトキシ、2 - クロロ - 2 , 2 - ジフルオロエトキシ、2 , 2 - ジクロロ - 2 - フルオロエトキシ、2 , 2 , 2 - トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシおよび1 , 1 , 1 - トリフルオロプロパ - 2 - オキシなどのC₁ - C₃ - ハロアルコキシ、

ハロアルキルチオ：(上述した通り)1個から8個の炭素原子を有する直鎖または分枝のアルキルチオ基、ここで、これらの基において、水素原子の一部または全部は上述した通りのハロゲン原子によって置き換えられていてよく、例えば、(これらに限定されないが)クロロメチルチオ、ブロモメチルチオ、ジクロロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、フルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロフルオロメチルチオ、ジクロロフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、1 - クロロエチルチオ、1 - ブロモエチルチオ、1 - フルオロエチルチオ、2 - フルオロエチルチオ、2 , 2 - ジフルオロエチルチオ、2 , 2 , 2 - トリフルオロエチルチオ、2 - クロロ - 2 - フルオロエチルチオ、2 - クロロ - 2 , 2 - ジフルオロエチルチオ、2 , 2 - ジクロロ - 2 - フルオロエチルチオ、2 , 2 , 2 - トリクロロエチルチオ、ペンタフルオロエチルチオおよび1 , 1 , 1 - トリフルオロプロパ - 2 - イルチオなどのC₁ - C₃ - ハロアルキルチオ、

ヘテロアリール：酸素、窒素および硫黄からなる群から1個から4個のヘテロ原子を含有する5員または6員の完全不飽和单環式環系；該環が複数の酸素原子を含有する場合、これらは直接隣接していない、

1個から4個の窒素原子または1個から3個の窒素原子、および1個の硫黄または酸素原子を含有する5員のヘテロアリール：炭素原子に加えて1個から4個の窒素原子または1個から3個の窒素原子、および1個の硫黄または酸素原子を環員として含有することができる5員のヘテロアリール基、例えば、(これらに限定されないが)2 - フリル、3 - フリル、2 - チエニル、3 - チエニル、2 - ピロリル、3 - ピロリル、3 - イソオキサゾリル、4 - イソオキサゾリル、5 - イソオキサゾリル、3 - イソチアゾリル、4 - イソチアゾリル、5 - イソチアゾリル、3 - ピラゾリル、4 - ピラゾリル、5 - ピラゾリル、2 - オキサゾリル、4 - オキサゾリル、5 - オキサゾリル、2 - チアゾリル、4 - チアゾリル、5 - チアゾリル、2 - イミダゾリル、4 - イミダゾリル、1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル、1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 5 - イル、1 , 2 , 4 - チアジアゾール - 3 - イル、1 , 2 , 4 - チアジアゾール - 5 - イル、1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - イル、1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル、1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - イルおよび1 , 3 , 4 - トリアゾール - 2 - イル；

窒素を介して結合しており、1個から4個の窒素原子を含有する5員のヘテロアリール、または窒素を介して結合しており、1個から3個の窒素原子を含有するベンゾ縮合した5員のヘテロアリール：炭素原子に加えて1個から4個の窒素原子および1個から3個の窒素原子をそれぞれ環員として含有することができ、2個の隣接する炭素環員、または窒素および隣接する炭素環員が、1個または2個の炭素原子が窒素原子によって置き換えられていてよいブタ - 1 , 3 - ジエン - 1 , 4 - ジイル基によって架橋されていてよい5員のヘテロアリール基、ここで、これらの環は窒素環員の1個を介して骨格に結合しており、例えば、(これらに限定されないが)1 - ピロリル、1 - ピラゾリル、1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル、1 - イミダゾリル、1 , 2 , 3 - トリアゾール - 1 - イル、1 , 3 , 4 - トリアゾール - 1 - イル、

1個から4個の窒素原子を含有する6員のヘテロアリール：炭素原子に加えて1個から3個または1個から4個の窒素原子を環員として含有することができる6員のヘテロア

10

20

30

40

50

リール基、例えば、(これらに限定されないが)2-ピリジニル、3-ピリジニル、4-ピリジニル、3-ピリダジニル、4-ピリダジニル、2-ピリミジニル、4-ピリミジニル、5-ピリミジニル、2-ピラジニル、1,3,5-トリアジン-2-イル、1,2,4-トリアジン-3-イルおよび1,2,4,5-テトラジン-3-イル、

1個から3個の窒素原子、または1個の窒素原子および1個の酸素もしくは硫黄原子を含有するベンゾ縮合した5員のヘテロアリール：例えば、(これらに限定されないが)1H-インドール-1-イル、1H-インドール-2-イル、1H-インドール-3-イル、1H-インドール-4-イル、1H-インドール-5-イル、1H-インドール-6-イル、1H-インドール-7-イル、1H-ベンゾイミダゾール-1-イル、1H-ベンゾイミダゾール-2-イル、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル、ベンゾイミダゾール-5-イル、1H-インダゾール-1-イル、1H-インダゾール-3-イル、1H-インダゾール-4-イル、1H-インダゾール-5-イル、1H-インダゾール-6-イル、1H-インダゾール-7-イル、2H-インダゾール-2-イル、1-ベンゾフラン-2-イル、1-ベンゾフラン-3-イル、1-ベンゾフラン-4-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、1-ベンゾフラン-6-イル、1-ベンゾフラン-7-イル、1-ベンゾチオフェン-2-イル、1-ベンゾチオフェン-3-イル、1-ベンゾチオフェン-4-イル、1-ベンゾチオフェン-5-イル、1-ベンゾチオフェン-6-イル、1-ベンゾチオフェン-7-イル、1,3-ベンゾチアゾール-2-イルおよび1,3-ベンゾオキサゾール-2-イル、

1個から3個の窒素原子を含有するベンゾ縮合した6員のヘテロアリール：例えば、(これらに限定されないが)キノリン-2-イル、キノリン-3-イル、キノリン-4-イル、キノリン-5-イル、キノリン-6-イル、キノリン-7-イル、キノリン-8-イル、イソキノリン-1-イル、イソキノリン-3-イル、イソキノリン-4-イル、イソキノリン-5-イル、イソキノリン-6-イル、イソキノリン-7-イルおよびイソキノリン-8-イル、

ヘテロシクリル：酸素、窒素および硫黄からなる群から1個から4個のヘテロ原子を含有する3員から15員の飽和または部分不飽和のヘテロ環：炭素環員に加えて1個から3個の窒素原子および/または1個の酸素原子もしくは硫黄原子または1個もしくは2個の酸素および/または硫黄原子を含有する単環式、二環式または三環式のヘテロ環；該環が複数の酸素原子を含有する場合、これらは直接隣接せず、例えば、(これらに限定されないが)オキシラニル、アジリジニル、2-テトラヒドロフラニル、3-テトラヒドロフラニル、2-テトラヒドロチエニル、3-テトラヒドロチエニル、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル、3-イソオキサゾリジニル、4-イソオキサゾリジニル、5-イソオキサゾリジニル、3-イソチアゾリジニル、4-イソチアゾリジニル、5-イソチアゾリジニル、3-ピラゾリジニル、4-ピラゾリジニル、5-ピラゾリジニル、2-オキサゾリジニル、4-オキサゾリジニル、5-オキサゾリジニル、2-チアゾリジニル、4-チアゾリジニル、5-チアゾリジニル、2-イミダゾリジニル、4-イミダゾリジニル、1,2,4-オキサジアゾリジン-3-イル、1,2,4-オキサジアゾリジン-5-イル、1,2,4-チアジアゾリジン-3-イル、1,2,4-チアジアゾリジン-5-イル、1,2,4-トリアゾリジン-3-イル、1,3,4-オキサジアゾリジン-2-イル、1,3,4-チアジアゾリジン-2-イル、1,3,4-トリアゾリジン-2-イル、2,3-ジヒドロフルール-2-イル、2,3-ジヒドロフルール-3-イル、2,4-ジヒドロフルール-2-イル、2,3-ジヒドロチエン-2-イル、2,4-ジヒドロチエン-2-イル、2,4-ジヒドロチエン-3-イル、2-ピロリン-2-イル、2-ピロリン-3-イル、3-ピロリン-2-イル、3-ピロリン-3-イル、2-イソオキサゾリン-3-イル、3-イソオキサゾリン-3-イル、4-イソオキサゾリン-3-イル、2-イソオキサゾリン-4-イル、3-イソオキサゾリン-4-イル、4-イソオキサゾリン-4-イル、2-イソオキサゾリン-5-イル、3-イソオキサゾリン-5-イル、4-イソオキサゾリン-5-イル、2-イソチアゾリン-3-イル、3-イソチアゾリン-3-イル、4-イソチアゾリン-3-イル、

10

20

30

40

50

ソチアゾリン - 3 - イル、 2 - イソチアゾリン - 4 - イル、 3 - イソチアゾリン - 4 - イル、 4 - イソチアゾリン - 4 - イル、 2 - イソチアゾリン - 5 - イル、 3 - イソチアゾリン - 5 - イル、 4 - イソチアゾリン - 5 - イル、 2 , 3 - ジヒドロピラゾール - 1 - イル、 2 , 3 - ジヒドロピラゾール - 2 - イル、 2 , 3 - ジヒドロピラゾール - 3 - イル、 2 , 3 - ジヒドロピラゾール - 4 - イル、 2 , 3 - ジヒドロピラゾール - 5 - イル、 3 , 4 - ジヒドロピラゾール - 1 - イル、 3 , 4 - ジヒドロピラゾール - 3 - イル、 3 , 4 - ジヒドロピラゾール - 4 - イル、 3 , 4 - ジヒドロピラゾール - 5 - イル、 4 , 5 - ジヒドロオピラゾール - 1 - イル、 4 , 5 - ジヒドロピラゾール - 3 - イル、 4 , 5 - ジヒドロピラゾール - 4 - イル、 4 , 5 - ジヒドロピラゾール - 5 - イル、 2 , 3 - ジヒドロオキサゾール - 2 - イル、 2 , 3 - ジヒドロオキサゾール - 3 - イル、 2 , 3 - ジヒドロオキサゾール - 4 - イル、 2 , 3 - ジヒドロオキサゾール - 5 - イル、 3 , 4 - ジヒドロオキサゾール - 2 - イル、 3 , 4 - ジヒドロオキサゾール - 3 - イル、 3 , 4 - ジヒドロオキサゾール - 4 - イル、 3 , 4 - ジヒドロオキサゾール - 5 - イル、 3 , 4 - ジヒドロオキサゾール - 2 - イル、 3 , 4 - ジヒドロオキサゾール - 3 - イル、 3 , 4 - ジヒドロオキサゾール - 4 - イル、 2 - ピペリジニル、 3 - ピペリジニル、 4 - ピペリジニル、 1 , 3 - ジオキサン - 5 - イル、 2 - テトラヒドロピラニル、 4 - テトラヒドロピラニル、 2 - テトラヒドロチエニル、 3 - ヘキサヒドロピリダジニル、 4 - ヘキサヒドロピリダジニル、 2 - ヘキサヒドロピリミジニル、 4 - ヘキサヒドロピリミジニル、 5 - ヘキサヒドロピリミジニル、 2 - ピペラジニル、 1 , 3 , 5 - ヘキサヒドロトリアジン - 2 - イルおよび 1 , 2 , 4 - ヘキサヒドロトリアジン - 3 - イル；

など、

脱離基 : S_N1 または S_N2 脱離基、例えば、ハロゲン(塩素、臭素、ヨウ素)、アルキルスルホネート(-OSO₂-アルキル、例えば、-OSO₂CH₃、-OSO₂CF₃)またはアリールスルホネート(-OSO₂-アリール、例えば、-OSO₂Ph、-OSO₂PhMe)。

2
[0 0 4 5]

含まれないものは、自然の法則に矛盾し、したがって当業者が自身の専門知識に基づいて除外したと思われる組合せである。含まれるものは、例えば、3個以上の隣接する酸素原子を有する環状構造である。

【発明を実施するための形態】

【 0 0 4 6 】

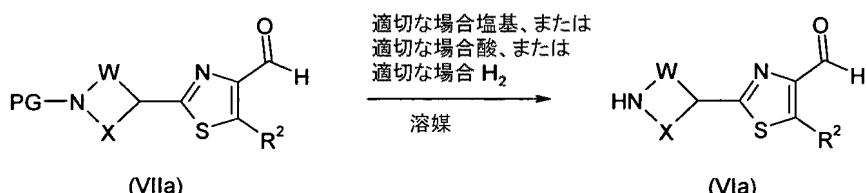
本発明はさらに、下記ステップ(a)から(g)の少なくとも1つを含む、本発明による式(I)の置換チアゾールを調製するための方法に関する。

[0 0 4 7]

(a) 下記反応スキーム(スキーム1)に従い、適切な場合溶媒の存在下、および適切な場合酸の存在下または適切な場合塩基の存在下または適切な場合水素の供給源の存在下で、式(VTIa)の化合物を式(VTia)の化合物に変換するステップ

[0 0 4 8]

【化 5】



(式中、

P G = アセチル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、ベンジルまたはベンジルオキシカルボニルである。

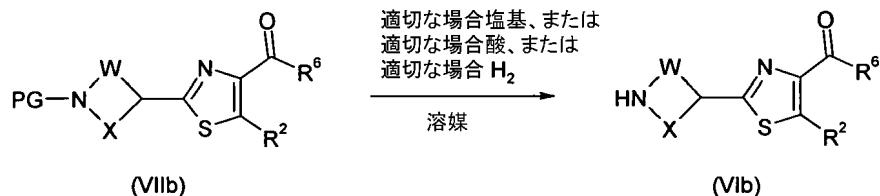
W、X、および R^2 は、上記式(Ⅰ)について定義した通りである。)。

【 0 0 4 9 】

(b) 下記反応スキーム(スキーム2)に従い、適切な場合溶媒の存在下、および適切な場合酸の存在下または適切な場合塩基の存在下または適切な場合水素の供給源の存在下で、式(VIIb)の化合物を式(VIb)の化合物に変換するステップ

【0050】

【化6】

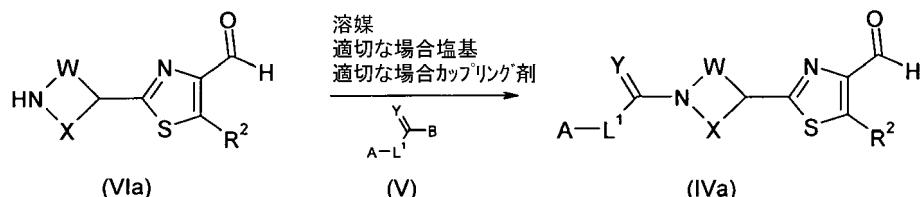


【0051】

(c) 下記反応スキーム(スキーム3)に従い、適切な場合カップリング剤、塩基および溶媒の存在下で、式(V)の化合物と式(VIa)の化合物との反応により式(IVa)の化合物を生成するステップ

【0052】

【化7】



(式中、

$\text{B} = \text{OH, 塩素、臭素またはヨウ素であり、}$

$\text{Y} = \text{酸素であり、}$

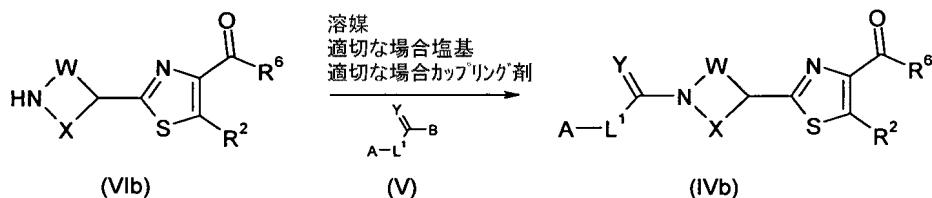
A, W, X, L^1 および R^2 は、上記式(I)に関して定義した通りである。)。

【0053】

(d) 下記反応スキーム(スキーム4)に従い、適切な場合カップリング剤、塩基および溶媒の存在下で、式(V)の化合物と式(VIb)の化合物との反応により式(IVb)の化合物を生成するステップ

【0054】

【化8】



(式中、

$\text{B} = \text{OH, 塩素、臭素またはヨウ素であり、}$

$\text{Y} = \text{酸素であり、}$

$\text{A, W, X, L}^1, \text{R}^6$ および R^2 は、上記式(I)に関して定義した通りである。)。

【0055】

(e) 下記反応スキーム(スキーム5)に従い、適切な場合塩基および溶媒の存在下で、式(II)または(III)の化合物と式(IVa)の化合物との反応により式(I)

10

20

30

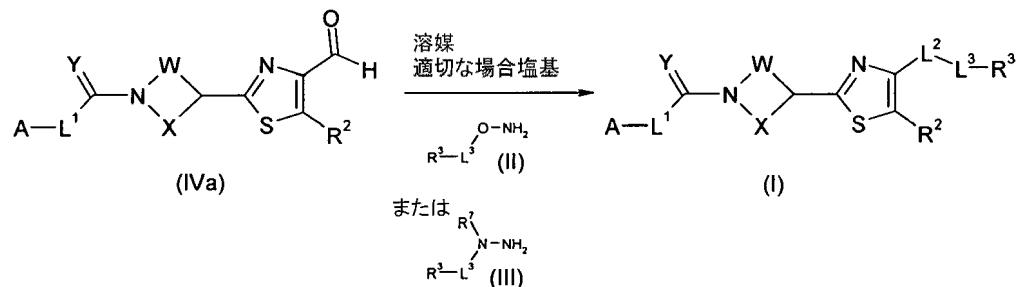
40

50

) の化合物を生成するステップ

【0056】

【化9】



10

(式中、

L^2 は、 $-\text{C}\text{H}=\text{N}-\text{O}-$ または $-\text{C}\text{H}=\text{N}-\text{N}(\text{R}^7)-$ - を表し、

Y = 酸素であり、

A 、 W 、 X 、 L^1 、 L^3 、 R^2 、 R^3 および R^7 は、上記式 (I) に関して定義した通りである。)。

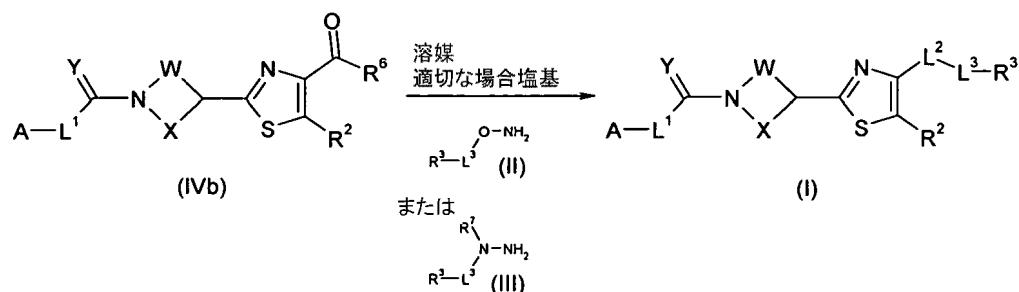
【0057】

20

(f) 下記反応スキーム (スキーム 6) に従い、適切な場合塩基および溶媒の存在中で、式 (II) または (III) の化合物と式 (IVb) の化合物との反応により式 (I) の化合物を生成するステップ

【0058】

【化10】



30

(式中、

L^2 は、 $-\text{C}(\text{R}^6)=\text{N}-\text{O}-$ または $-\text{C}(\text{R}^6)=\text{N}-\text{N}(\text{R}^7)-$ - を表し、

Y = 酸素であり、

A 、 W 、 X 、 L^1 、 L^3 、 R^2 、 R^3 、 R^6 および R^7 は、上記式 (I) に関して定義した通りである。)。

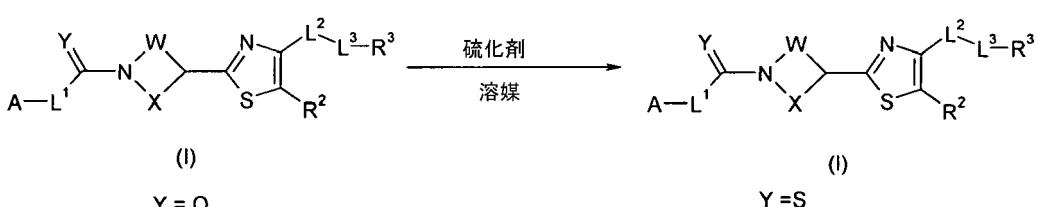
【0059】

40

(g) 下記反応スキーム (スキーム 7) に従い、硫化剤の存在下および適切な場合溶媒の存在下で、式 (I) の化合物を式 (I') の化合物に変換するステップ

【0060】

【化11】



50

【 0 0 6 1 】

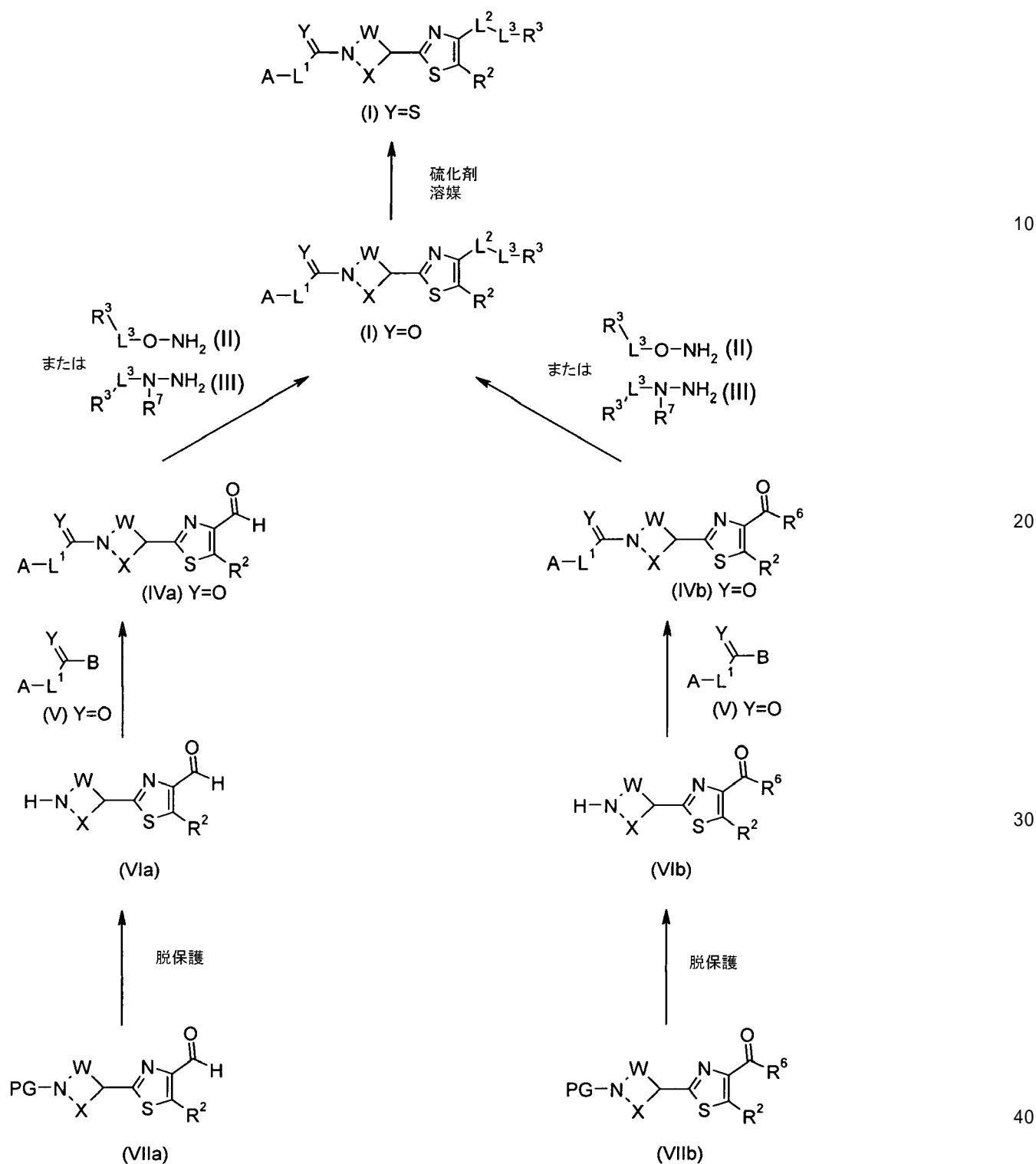
合成経路の一般的概要はスキーム 8 に示す。

【 0 0 6 2 】

P G を標識した式 (V I I a) または (V I I b) の化合物の保護基を除去し、こうして式 (V I a) もしくは (V I b) の化合物、または対応する塩を形成する (スキーム 1 および 2)。式 (V I a) もしくは (V I b) の化合物または対応する塩を式 (V) の基質とカップリングし、これにより式 (I V a) または (I V b) の化合物を調製することが可能になる (スキーム 3 および 4)。一般式 (I V a) または (I V b) の化合物を次いで、式 (I I) のヒドロキシルアミンまたは式 (I I I) のヒドラジンと反応させることにより、式 (I) (スキーム 5 および 6) の化合物を生成する。硫化剤を式 (I) の化合物に添加することにより、式 (I) の化合物を生成する (スキーム 7)。
10

【 0 0 6 3 】

【化12】
スキーム8



【0064】

対応する化合物 (VIIa) から中間体 (Vla) を調製する一方法は、スキーム1に示されている。

【0065】

一般式 (VIIa) の化合物を、保護基を除去することに関する文献上に記載されている適当な方法によって一般式 (Vla) の対応する化合物に変換する (「Protective Groups in Organic Synthesis」; 第3版; Theodore W. Greene, Peter G. M. Wuts; 494 - 653、およ

びそこに引用されている文献)。

【0066】

t - プトキシカルボニル保護基およびベンジルオキシカルボニル保護基は、酸性媒質中で(例えば、塩酸またはトリフルオロ酢酸を使用して)除去することができる。アセチル保護基は、塩基性条件下で(例えば炭酸カリウムまたは炭酸セシウムを使用して)除去することができる。ベンジル位の保護基は、水素を使用して触媒(例えば、活性炭上のパラジウム)の存在下で水素化分解的に除去することができる。

【0067】

溶媒として使用に適當なものは、該反応条件下で不活性である全ての通例の溶媒、例えば、アルコール(例えば、メタノール、エタノール、プロパンノール)、環式および非環式のエーテル(例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン)、芳香族炭化水素(例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン)、ハロゲン化炭化水素(例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素)、ハロゲン化芳香族炭化水素(例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン)、ニトリル(例えば、アセトニトリル)、カルボン酸エステル(例えば、酢酸エチル)、アミド(例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド)、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリノン、水および酢酸などであり、または該反応は、これらの溶媒の2つ以上の混合物中で実施することができる。

10

【0068】

t - プトキシカルボニル基およびベンジルオキシカルボニル基を脱保護するこの反応のために使用することができる酸は、例えば、文献上に記載されている通り、トリフルオロ酢酸、塩酸または他の酸である(例えば、「Protective Groups in Organic Synthesis」; 第3版; Theodore W. Greene, Peter G. M. Wuts; 494 - 653頁)。

20

【0069】

該反応は、0 - 150 の温度、好ましくは室温で通常実施されるが、反応混合物の還流温度で実施することもできる。反応時間は、該反応の規模および反応温度に依存して変動するが、一般に半時間から72時間の間である。

【0070】

該反応が終了した後、化合物(VIa)は、通例の分離技術の1つを使用して反応混合物から除去される。必要であれば、該化合物は、再結晶、蒸留またはクロマトグラフィーによって精製され、または適切な場合、事前に精製することなく次のステップに使用することもできる。さらに、一般式(VIa)の化合物を塩として、例えば塩酸またはトリフルオロ酢酸の塩として単離することが可能である。

30

【0071】

中間体(VIb)は、スキーム2に示されている通り、上記されている方法と同様に、対応する化合物(VIIb)から合成することができる。

【0072】

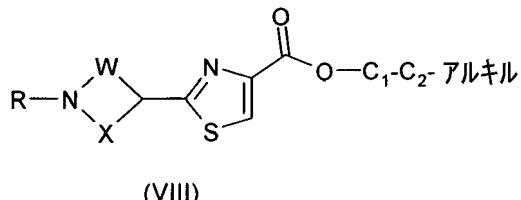
式(VIIa)のアルデヒドは市販で入手可能である(例えば、Maybridge)、または文献上に記載されている方法、例えばハンチ合成によって、市販で入手可能な前駆体から調製することができる。アルデヒド(VIIa)は、例えば、テトラヒドロフラン中0 にて水素化アルミニウムリチウムで還元、続いて室温にてジクロロメタン中で、Dess Martin試薬で対応するアルコールを酸化することによって、対応するメチルまたはエチルエステル(VIII)から調製される(例えば、水素化アルミニウムリチウムでの還元に関してはWO 07/147336およびWO 07/039177、およびDess Martin試薬での酸化に関してはJ. Am. Chem. Soc. 1978, 100, 300 - 301; 1979, 101, 5294 - 5299; 1991, 113, 7277 - 7287を参照のこと。)。

40

【0073】

【化 1 3】

义 1



(式中、

R = H、または例えば t - プトキシカルボニル (t B o c) もしくはベンジルオキシカルボニル (C b z) などの酸不安定性アミン保護基、または例えばベンジル (B n) などのベンジル保護基。

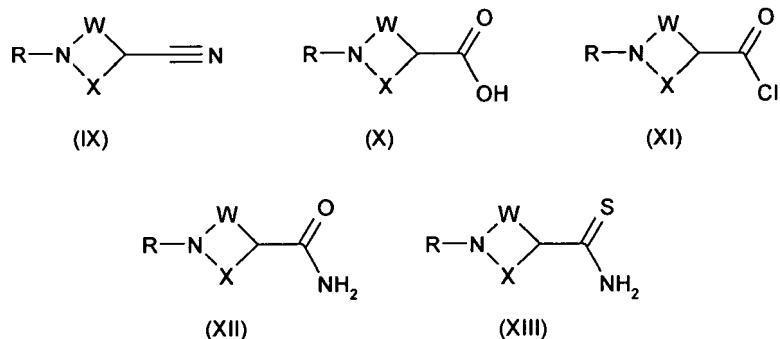
WおよびXは、上記式(Ⅰ)に関して定義した通りである。)

メチルエステルまたはエチルエステル(ⅤⅠⅠⅠ)は知られており、文献上に記載されている手順によって、市販で入手可能な前駆体、例えば式(IX)のニトリル、式(X)のカルボン酸、式(XI)の塩化カルボニル、式(XII)のアミドまたは式(XIII)のチオアミドから調製することができる(図1)。好ましい方法はハンチチアゾール合成である。(XIII)および市販で入手可能なハロビルビン酸エチルまたはハロビルビン酸メチルで出発、エタノールまたはN,N-ジメチルホルムアミド中、例えば、トリエチルアミンの存在下、室温(例えば、WO 07/014290およびそこに引用されている文献を参照のこと。)。

[0 0 7 4]

【化 1 4】

2



(式中、

$R = H$ 、または例えば t -ブトキシカルボニル (t B o c) もしくはベンジルオキシカルボニル ($C_b z$) などの酸不安定性アミン保護基、または例えばベンジル (B_n) などのベンジル保護基。

WおよびXは、上記式(I)に関して定義した通りである。)。

【 0 0 7 5 】

ケトン（VIIb）は、文献上に記載されている手順によって、市販で入手可能な前駆体から調製することができる。ケトン（VIIb）は、例えば、有機金属試薬R⁶-M（例えば、M=Mg、Li）の添加、続いて対応するアルコールの酸化によって、対応するアルデヒド（VIIa）から調製される。ケトン（VIIb）は、テトラヒドロフラン中-78にて不活性ガスの雰囲気下でグリニヤール試薬R⁶-MgX（X=Cl、BrまたはI）の添加（例えば、WO 07/039177を参照のこと。）、続いて室温でジクロロメタン中Dess-Martin試薬での対応するアルコールの酸化によって調製するのが好ましい（例えば、水素化アルミニウムリチウムでの還元にはWO 07/147336もしくはWO 07/039177、およびDess-Martin試薬での酸化にはJ. Am. Chem. Soc. 1978, 100, 300-301; 1979, 101, 5294-5299; 1991, 113, 7277-7287を参照のこと。）。

0 1 、 5 2 9 4 - 5 2 9 9 : 1 9 9 1 、 1 1 3 、 7 2 7 7 - 7 2 8 7 を参照のこと。)))

【0076】

対応する化合物(VIa)から式(IVa)の化合物を調製する一方法は、スキーム3に示されている。

【0077】

一般式(IVa)の化合物は、適切な場合酸スカベンジャー／塩基の存在下で、対応する一般式(VIa)の化合物と一般式(V)(式中、B=C1)の基質とのカップリング反応によって合成することができる。

【0078】

溶媒として使用に適當なものは、該反応条件下で不活性である全ての通例の溶媒、例えばアルコール(例えば、メタノール、エタノール、プロパノール)、環式および非環式のエーテル(例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン)、芳香族炭化水素(例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン)、ハロゲン化炭化水素(例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素)、ハロゲン化芳香族炭化水素(例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン)およびニトリル(例えば、アセトニトリル)などであり、または該反応は、これらの溶媒の2つ以上の混合物中で実施することができる。好ましい溶媒はテトラヒドロフランおよびジクロロメタンである。

10

【0079】

一般式(VIa)の出発原料に対して少なくとも1当量の酸スカベンジャー／塩基(例えば、Hunig塩基、トリエチルアミンまたは市販のポリマー酸スカベンジャー)を用いる。出発原料が塩である場合、少なくとも2当量の酸スカベンジャーが必要とされる。

20

【0080】

該反応は0 - 100 の温度、好ましくは20 - 30 で通常実施されるが、反応混合物の還流温度で実施することもできる。反応時間は、反応の規模および反応温度に依存して変動するが、一般に数分から48時間の間である。

【0081】

該反応が終了した後、化合物(IVa)は、通例の分離技術の1つを使用して反応混合物から除去される。必要であれば、該化合物は、再結晶、蒸留またはクロマトグラフィーによって精製され、または適切な場合、事前に精製することなく次のステップに使用することもできる。

30

【0082】

別法として、式(IVa)の化合物は、一般式(V)(式中、B=OH)の基質を使用して、カップリング剤の存在下で文献上に記載されている手順と同様に、一般式(VIa)の対応する化合物から合成することができる(例えば、Tetrahedron 2005, 61, 10827 - 10852、およびそこに引用されている文献)。

【0083】

適當なカップリング剤は、例えば、ペプチドカップリング剤(例えば、4-ジメチルアミノピリジンと混合されたN-(3-ジメチルアミノプロピル)-N'-エチルカルボジイミド、1-ヒドロキシベンゾトリアゾールと混合されたN-(3-ジメチルアミノプロピル)-N'-エチルカルボジイミド、プロモトリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、O-(7-アザベンゾトリアゾール-1-イル)-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェートなど)である。

40

【0084】

適切な場合、例えばトリエチルアミンまたはHunig塩基などの塩基は、該反応に用いることができる。

【0085】

溶媒として使用に適當なものは、該条件下で不活性である全ての通例の溶媒、例えばアルコール(例えば、メタノール、エタノール、プロパノール)、環式および非環式のエーテル(例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン)、芳香族炭化水素(例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン)、ハロゲン化炭化水素(例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素)、ハロゲン化芳香族炭化水素(例えば、クロロベンゼ

50

ン、ジクロロベンゼン)、ニトリル(例えば、アセトニトリル)およびアミド(例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド)などであり、または該反応は、これらの溶媒の2つ以上の混合物中で実施することができる。好ましい溶媒はN,N-ジメチルホルムアミドおよびジクロロメタンである。

【0086】

該反応は、0 - 100 の温度、好ましくは0 - 30 で通常実施されるが、反応混合物の還流温度で実施することもできる。反応時間は、反応の規模および反応温度に依存して変動するが、一般に数分から48時間の間である。

【0087】

反応が終了した後、化合物(IVa)は、通例の分離技術の1つを使用して反応混合物から除去される。必要であれば、該化合物は、再結晶、蒸留またはクロマトグラフィーによって精製され、または適切な場合、事前に精製することなく次のステップに使用することもできる。

【0088】

酸ハロゲン化物(V)(B=ハロゲン)または対応するカルボン酸(V)(B=OH)は市販されており、または文献上に記載されている方法によって調製することができる。さらに、一般式(V)(式中、B=Cl)の基質は、文献(例えば、Tetrahedron 2005, 61, 10827 - 10852、およびそれに引用されている文献)から公知の方法を使用する塩素化によって、対応する酸(B=OH)から調製することができる。

10

20

30

40

【0089】

中間体(IVb)は、スキーム4に示されている通り、上記されている方法と同様に対応する化合物(VIb)から合成することができる。

【0090】

Yが酸素を表す式(I)の化合物を対応する化合物(IVa)から調製する一方法は、スキーム5に示されている。

【0091】

一般式(I)の化合物は、適切な場合酸、酸スカベンジャー/塩基またはイオン交換体の存在下で、対応する一般式(IVa)の化合物と一般式(II)または(III)の基質との縮合反応によって合成することができる。

【0092】

適切な場合、例えば塩酸などの酸、または例えばトリエチルアミン、Hunig塩基などの塩基、または例えばAmberlyst A21などのイオン交換体が、該反応において使用され得る。

【0093】

溶媒として使用に適當なものは、該条件下で不活性である全ての通例の溶媒、例えばアルコール(例えば、メタノール、エタノール、プロパノール)、環式および非環式のエーテル(例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン)、芳香族炭化水素(例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン)、ハロゲン化炭化水素(例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素)、ハロゲン化芳香族炭化水素(例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン)、ニトリル(例えば、アセトニトリル)およびアミド(例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド)などであり、または該反応は、これらの溶媒の2つ以上の混合物中で実施することができる。好ましい溶媒はエタノールである。

【0094】

該反応は、0 - 100 の温度、好ましくは0 - 30 で通常実施されるが、反応混合物の還流温度で実施することもできる。反応時間は、反応の規模および反応温度に依存して変動するが、一般に数分から48時間の間である。

【0095】

反応が終了した後、化合物(I)は、通例の分離技術の1つを使用して反応混合物から

50

除去される。必要であれば、該化合物は、再結晶、蒸留またはクロマトグラフィーによって精製され、または適切な場合、事前に精製することなく次のステップに使用することもできる。

【0096】

オキシム(II)およびヒドラジン(III)もしくは塩酸の対応する塩は市販されており、または文献上に記載されている方法によって調製することができる(Chem. Eur. J. 2005, 11, 6974 - 6981およびChem. Soc. Rev., 2001, 30, 205 - 213を参照のこと。)。

【0097】

Yが酸素を表す化合物(I)は、スキーム6に示されている通り、上記されている方法と同様に、対応する化合物(IVb)から合成することができる。 10

【0098】

Yが酸素を表す対応する化合物(I)からY = 硫黄である式(I)の化合物を調製する一方法は、スキーム7に示されている。

【0099】

溶媒として使用に適當なものは、該条件下で不活性である全ての通例の溶媒、例えばアルコール(例えば、メタノール、エタノール、プロパノール)、環式および非環式のエーテル(例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン)、芳香族炭化水素(例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン)、ハロゲン化炭化水素(例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素)、ハロゲン化芳香族炭化水素(例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン)、ニトリル(例えば、アセトニトリル)、カルボン酸エステル(例えば、酢酸エチル)およびアミド(例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド)などであり、該反応は、これらの溶媒の2つ以上の混合物中で実施することができる。好ましい溶媒はクロロホルムおよび1,2-ジメトキシエタンである。 20

【0100】

適當な硫化剤は、例えばローソン試薬(Tetrahedron 1986, 42, 6555 - 6564, Tetrahedron Lett. 1993, 46, 7459 - 7462を参照のこと。)および五硫化リンである。出発原料および硫化剤は等モル量で用いられるが、硫化剤は適切な場合、過剰に使用することもできる。 30

【0101】

該反応は、0 - 150 の温度、好ましくは0 - 100 で通常実施されるが、反応混合物の還流温度で実施することもできる。反応時間は、反応の規模および反応温度に依存して変動するが、一般に数分から48時間の間である。

【0102】

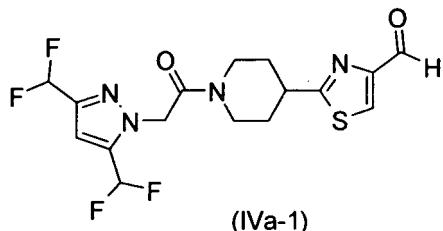
反応が終了した後、化合物(I)は、通例の分離技術の1つを使用して反応混合物から除去され、必要であれば、該化合物は、再結晶、蒸留またはクロマトグラフィーによって精製される。

【0103】

化合物(IVa-1)

【0104】

【化15】



は新規である。

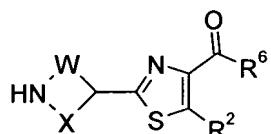
50

【0105】

式(IVb)

【0106】

【化16】



(IVb)

10

(式中、

記号は下記の意味を有する。

W、X、R²およびR⁶は、上記で示されている一般の意味、好ましい意味、特に好ましい意味、または非常に特に好ましい意味を有する。)

の化合物およびこれらの塩は新規である。

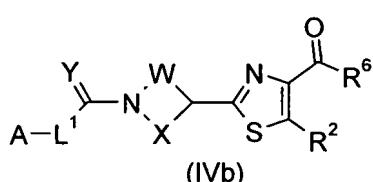
【0107】

式(IVb)

【0108】

【化17】

20



(IVb)

(式中、

記号は下記の意味を有する。

A、L¹、Y、W、X、R²およびR⁶は、上記で示されている一般の意味、好ましい意味、特に好ましい意味、または非常に特に好ましい意味を有する。)

の化合物は新規である。

30

【0109】

式(I)の化合物を調製するための本発明による方法は、1つ以上の反応助剤を使用して実施するのが好ましい。

【0110】

適当な反応助剤は、適切な場合、通例の無機塩基もしくは有機塩基または酸受容体である。これらとして、例えば酢酸ナトリウム、酢酸カリウムもしくは酢酸カルシウム、リチウムアミド、ナトリウムアミド、カリウムアミドもしくはカルシウムアミド、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムもしくは炭酸カルシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムもしくは炭酸水素カルシウム、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウムもしくは水素化カルシウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムもしくは水酸化カルシウム、ナトリウムメトキシド、エトキシド、n-もしくはイソプロポキシド、n-、イソ-、s-もしくはt-ブトキシド、またはカリウムメトキシド、エトキシド、n-もしくはイソプロポキシド、n-、イソ-、s-もしくはt-ブトキシドなど、アルカリ金属またはアルカリ土類金属の酢酸塩、アミド、炭酸塩、重炭酸塩、水素化物、水酸化物またはアルコキシド、さらに例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、トリブチルアミン、エチルジイソプロピルアミン、N,N-ジメチルシクロヘキシルアミン、ジシクロヘキシルアミン、エチルジシクロヘキシルアミン、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、2-メチル-、3-メチル-、4-メチル-、2,4-ジメチル-、2,6-ジメチル-、3,4-ジメチル-および3,5-ジメチルピリジン、5-エチル-2-メチルピリジン、4-ジメチルアミノピ

40

50

リジン、N-メチルピペリジン、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]-オクタン(DABC_O)、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]-ノナ-5-エン(DBN)または1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-ウンデカ-7-エン(DBU)などの塩基性有機窒素化合物も好ましく挙げられる。

【0111】

本発明による方法は、1つ以上の希釈剤を使用して実施するのが好ましい。適当な希釈剤は、実質的に全ての不活性な有機溶媒である。これらとしてペンタン、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、石油エーテル、ベンジン、リグロイン、ベンゼン、トルエン、キシレン、塩化メチレン、塩化エチレン、クロロホルム、四塩化炭素、クロロベンゼンおよびo-ジクロロベンゼンなどの、脂肪族および芳香族の、任意にハロゲン化されている炭化水素、ジエチルエーテルおよびジブチルエーテル、グリコールジメチルエーテルおよびジグリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフランおよびジオキサンなどのエーテル、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソプロピルケトンまたはメチルイソブチルケトンなどのケトン、酢酸メチルまたは酢酸エチルなどのエステル、例えばアセトニトリルまたはプロピオ-ニトリルなどのニトリル、例えばジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドおよびN-メチルピロリドンなどのアミド、ならびにさらにジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホンおよびヘキサメチルリン酸トリアミド、およびDMPUが好ましく挙げられる。

【0112】

本発明による方法において、反応温度は、比較的広い範囲内で変動し得る。一般に、該方法は、0から250の間の温度、好ましくは10から185の間の温度で実施される。

【0113】

本発明による方法は、大気圧下で一般に実施される。しかし、高圧または減圧下で操作することも可能である。

【0114】

本発明による方法を実施するため、各場合に必要とされる出発原料は、およそ等モル量で一般に用いられる。しかし、各場合において、使用される構成成分の1つを比較的大過剰で使用することも可能である。本発明による方法における後処理は、各場合において、通例の方法によって実施される(調製実施例を参照。)。

【0115】

本発明はさらに、望まれない微生物を防除するための本発明によるチアゾリルオキシムエーテルおよびヒドラゾンの非医薬的使用を提供する。

【0116】

本発明はさらに、本発明による少なくとも1種のヘテロシクリル置換チアゾールを含む、望まれない微生物を防除するための組成物に関する。

【0117】

さらに、本発明は、本発明によるチアゾリルオキシムエーテルおよびヒドラゾンが微生物および/またはこれらの生息地に施用されることを特徴とする、望まれない微生物を防除するための方法に関する。

【0118】

本発明はさらに、本発明による少なくとも1種のヘテロシクリル置換チアゾールで処理される種子に関する。

【0119】

本発明の最後の対象は、本発明による少なくとも1種のヘテロシクリル置換チアゾールで処理された種子を使用することによる、望まれない微生物から種子を保護するための方法に関する。

【0120】

本発明による化合物は強力な殺菌作用を有し、作物保護および材料の保護において、真菌および細菌などの望まれない微生物を防除するために使用することができる。

10

20

30

40

50

【0121】

本発明による式(I)のチアゾリルオキシムエーテルおよびヒドラゾンは、非常に良好な殺真菌特性を有し、作物保護、例えば、ネコブカビ類(*Plasmadiophoromycetes*)、卵菌類(*Oomycetes*)、ツボカビ類(*Chytridiomycetes*)、接合菌類(*Zygomycetes*)、子囊菌類(*Ascomycetes*)、担子菌類(*Basidiomycetes*)および不完全菌類(*Deutero-mycetes*)を防除するために使用することができる。

【0122】

作物保護において、殺菌剤は、例えば、プセウドモナダケアエ(*Pseudomonadaceae*)、リゾビアセア(*Rhizobiaceae*)、エンテロバクテリアセア(*Enterobacteriaceae*)、コリュネバクテリアケアエ(*Corynebacteriaceae*)およびストレプトミュケタケアエ(*Streptomycetaceae*)を防除するために使用することができる。
10

【0123】

本発明による殺真菌性組成物は、植物病原性真菌の治癒的または保護的防除のために使用することができる。すなわち、本発明は、種子、植物または植物部位、果実、または植物が生育する土壤に施用される本発明による活性化合物または組成物を使用する、植物病原性真菌を防除するための治癒的および保護的方法にも関する。

【0124】

作物保護における植物病原性真菌を防除するための本発明による組成物は、有効だが非植物毒性の量の本発明による活性化合物を含む。「有効だが非植物毒性の量」は、満足のいく方法で植物の真菌性疾患を防除するまたは完全に真菌性疾患を根絶するのに十分であり、同時に植物毒性の任意の顕著な症状を引き起こすことがない本発明の組成物の量を意味する。一般に、この施用量は、比較的広い範囲内で変動し得る。これは、複数の因子、例えば、防除される真菌、植物、気候条件、および本発明による組成物の成分に依存する。
20

【0125】

本発明によると、全ての植物および植物部分を処理することが可能である。植物は、本明細書において、望まれるおよび望まれない野草または作物植物(自然発生型作物植物を含める。)など全ての植物および植物集団を意味すると理解されるべきである。作物植物は、トランスジェニック植物および品種所有権によって保護され得るもしくは保護され得ない植物品種を含めて、従来の育種および最適化の方法によって、または生物工学的および遺伝子工学的方法、もしくはこれらの方法の組合せによって得ることができる植物であり得る。植物部分は、苗条、葉、花および根など植物の全ての地上部および地下部ならびに器官を意味すると理解されるべきであり、挙げることができる例は、葉、針葉、茎、樹幹、花、果実身体、果実および種子、ならびにさらに根、塊茎および根茎である。植物部位として、収穫器官ならびに栄養繁殖器官および生殖繁殖器官、例えば、実生、塊茎、根茎、挿し木および種子も挙げられる。
30

【0126】

以下の植物は、本発明に従って処理することができる植物として挙げることができる。ロサケアエ属種(*Rosaceae sp.*)(例えば、リンゴおよびセイヨウナシなどリンゴ類の果実だけでなく、アンズ、サクランボ、アーモンドおよびモモなどの核果、ならびにさらにイチゴなどの軟果実)、リベシオイダエ属種(*Ribesioidae sp.*)、ユグランダケアエ属種(*Juglandaceae sp.*)、ベトウラケアエ属種(*Betulaceae sp.*)、アナカルディアケアエ属種(*Anacardiaceae sp.*)、ファガケアエ属種(*Fagaceae sp.*)、モラケアエ属種(*Moraceae sp.*)、オレアケアエ属種(*Oleaceae sp.*)、アクティニダケアエ属種(*Actinidiaceae sp.*)、ラウラケアエ属種(*Lauraceae sp.*)、ムサケアエ属種(*Musaceae sp.*)(例えば、バナナの木およびプランテーション)、ルビアケアエ属種(*Rubiaceae sp.*)
40
50

(例えば、コーヒー)、テアケア工属種 (*Theaceae* sp.)、ステルクリケア工属種 (*Sterculiceae* sp.)、ルタケア工属種 (*Rutaceae* sp.) (例えば、レモン、オレンジおよびグレープフルーツ)、ソラナケア工属種 (*Solanaceae* sp.) (例えば、トマト)、リリアケア工属種 (*Liliaceae* sp.)、アステラケア工属種 (*Asteraceae* sp.) (例えば、レタス)、ウムベッリフェラ工属種 (*Umbelliferae* sp.)、クルキフェラ工属種 (*Cruciferae* sp.)、ケノポディアケア工属種 (*Chenopodiaceae* sp.) (例えば、キュウリ)、アッリアケア工属種 (*Alliaceae* sp.) (例えば、ニラ、タマネギ)、パピリオナケア工属種 (*Papilionaceae* sp.) (例えば、エンドウマメ)などの綿、亜麻、ブドウ、果実、野菜；グラミニア工属種 (*Gramineae* sp.) (例えば、トウモロコシ、菌叢、コムギ、ライムギ、イネ、オオムギ、カラスムギ、アワおよびライコムギなどの穀類)、アステラケア工属種 (*Asteraceae* sp.) (例えば、ヒマワリ)、 brassicae 工属種 (*Brassicaceae* sp.) (例えば、白キャベツ、赤キャベツ、プロッコリー、カリフラワー、芽キャベツ、チンゲン菜、カブキャベツ、二十日大根、ならびにさらにアブラナ、カラシナ、セイヨウワサビおよびクレソン)、ファバカ工属種 (*Fabaceae* sp.) (例えば、マメ、ピーナッツ)、パピリオナケア工属種 (*Papilionaceae* sp.) (例えば、大豆)、ソラナケア工属種 (*Solanaceae* sp.) (例えば、ジャガイモ)、ケノポディアケア工属種 (*Chenopodiaceae* sp.) (例えば、サトウダイコン、飼料ビート、フダンソウ、ビート)など主要な作物植物；庭園および森林における作物植物および装飾用植物；ならびにさらに各場合におけるこれらの植物の遺伝子組換え種。
10
20

【0127】

本発明に従って処理することができる真菌性疾患の一部の病原体を一例として挙げることができるが、制限として挙げるものではない。

【0128】

例えば、ブルメリア属各種 (*Blumeria species*)、例えばブルメリア・グラミニス (*Blumeria graminis*)など；ポドスパエラ属各種 (*Podosphaera species*)、例えばポドスパエラ・レウコトリカ (*Podosphaera leucotricha*)など；スパエロテカ属各種 (*Sphaerotilotheca species*)、例えばスパエロテカ・フリギネア (*Sphaerotilotheca fuliginea*)など；ウンキヌラ属各種 (*Uncinula species*)、例えばウンキヌラ・ネカトル (*Uncinula necator*)など；などのうどんこ病の病原体に起因する疾患、
30

例えば、ギュムノスボランギウム属各種 (*Gymnosporangium species*)、例えばギュムノスボランギウム・サビナエ (*Gymnosporangium sabinae*)など；ヘミレイア属各種 (*Hemileia species*)、例えばヘミレイア・ワスタトリクス (*Hemileia vastatrix*)など；パコプソラ属各種 (*Phakopsora species*)、例えばパコプソラ・パキュリジ (*Phakopsora pachyrhizici*)およびパコプソラ・メイボミアエ (*Phakopsora meibomiae*)など；プッキニア属各種 (*Puccinia species*)、例えば、プッキニア・レコンディタ (*Puccinia recondita*)、プッキニア・グラミニス (*Puccinia graminis*)またはプッキニア・ストリホルミス (*Puccinia striiformis*)など；ウロミュケス属各種 (*Uromyces species*)、例えばウロミュケス・アップディクラトゥス (*Uromyces appendiculatus*)など；などのさび病の病原体に起因する疾患、
40

例えば、アルブゴ属各種 (*Albugo*)、例えばアルブゴ・クンジダ (*Albugo cundida*)など、ブレミア属各種 (*Bremia species*)、例えばブ

10

20

30

40

50

レミア・ラクトウカエ (*Bremia lactucae*) など; ペロノスボラ属各種 (*Peronospora species*)、例えばペロノスボラ・ピシ (*Peronospora pisii*) または *P. brassicaceae* など; ピュトプトラ属各種 (*Phytophthora species*)、例えばピュトプトラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*) など; プラスマバラ属各種 (*Plasmopara species*)、例えばプラスマバラ・ヴィティコラ (*Plasmopara viticola*) など; プセウドペロノスボラ属各種 (*Pseudoperonospora species*)、例えばプセウドペロノスボラ・フムリ (*Pseudoperonospora humuli*) または *Pseudoperonospora cubensis* など; ピュティウム属各種 (*Pythium species*)、例えばピュティウム・ウルティムム (*Pythium ultimum*) など; などの卵菌類 (*Oomycetes*) の群からの病原体に起因する疾患、

例えば、アルテルナリア属各種 (*Alternaria species*)、例えばアルテルナリア・ソラニ (*Alternaria solani*) など; ケルコスボラ属各種 (*Cercospora species*)、例えばケルコスボラ・ベティコラ (*Cercospora beticola*) など; クラディオスボリウム属各種 (*Cladodisporium species*)、例えばクラディオスボリウム・ククメリヌム (*Cladodisporium cucumerinum*) など; コクリオボルス属各種 (*Cochliobolus species*)、例えば、コクリオボルス・サティウス (*Cochliobolus sativus*) (分生子形態: ドレクスレラ (*Drechslera*)) またはコクリオボルス・ミユアベアヌス (*Cochliobolus miyabeanus*) など; コッレトトリクム属各種 (*Colletotrichum species*)、例えばコッレトトリクム・リンデムタニウム (*Colletotrichum lindemuthianum*) など; キュクロコニウム属各種 (*Cycloconium species*)、例えばキュクロコニウム・オレアギヌム (*Cycloconium oleaginum*) など; ディアポルテ属各種 (*Diaporthe species*)、例えばディアポルテ・キトリ (*Diaporthe citri*) など; エルシノエ属各種 (*Elsinoe species*)、例えばエルシノエ・ファウケッティイ (*Elsinoe fawcettii*) など; グロエオスボリウム属各種 (*Gloeosporium species*)、例えばグロエオスボリウム・ラエティコロル (*Gloeosporium laeticolor*) など; グロメレッラ属各種 (*Glomerella species*)、例えばグロメレッラ・キングラタ (*Glomerella cingulata*) など; グイグナルディア属各種 (*Guignardia species*)、例えばグイグナルディア・ビドウェッリ (*Guignardia bidwellii*) など; レプトスパエリア属各種 (*Leptosphaeria species*)、例えばレプトスパエリア・マクランス (*Leptosphaeria maculans*) など; マグナポルテ属各種 (*Magnaporthe species*)、例えばマグナポルテ・グリセア (*Magnaporthe grisea*) など; ミクロドキウム属各種 (*Microdochium species*)、例えばミクロドキウム・ニバル (*Microdochium nivale*) など; ミュコスパエレッラ属各種 (*Mycosphaerella species*)、例えばミュコスパエレッラ・グラミニコラ (*Mycosphaerella graminicola*)、ミュコスパエレッラ・アラキディコラ (*Mycosphaerella arachidicola*) またはミュコスパエレッラ・フィイエンシス (*Mycosphaerella fijiensis*) など; パエオスパエリア属各種 (*Phaeosphaeria species*)、例えばパエオスパエリア・ノドルム (*Phaeosphaeria nodorum*) など; ピュレノボラ属各種 (*Pyrenophora species*)、例えばピュレノボラ・テレス (*Pyrenophora teres*) またはピュレノボラ・トリティキ・

10

20

30

40

50

レペンティス (*Pyrenophora tritici repentis*) など ; ラムラリア属各種 (*Ramularia species*) 、例えばラムラリア・コロシグニ (*Ramularia collocygni*) またはラムラニア・アレオラ (*Ramulania areola*) など ; リュンコスボリウム属各種 (*Rhynchosporium species*) 、例えばリュンコスボリウム・セカリス (*Rhynchosporium secalis*) など ; セプトリア属各種 (*Septoria species*) 、例えばセプトリア・アピイ (*Septoria apii*) またはセプトリア・リュコペルシキ (*Septoria lycopersici*) など ; スタゴノスボラ属各種 (*Stagonospora species*) 、例えばスタゴノスボラ・ノドルム (*Stagonospora nodorum*) など ; テュプラ属各種 (*Typhula species*) 、例えばテュプラ・インカルナタ (*Typhula incarnata*) など ; ウェントウリア属各種 (*Venturia species*) 、例えばウェントウリア・イナエクワリス (*Venturia inaequalis*) など ; に起因する葉枯病および葉萎凋病。

例えば、コルティキウム属各種 (*Corticium species*) 、例えばコルティキウム・グラミネアルム (*Corticium graminearum*) など ; フサリウム属各種 (*Fusarium species*) 、例えばフサリウム・オクシスボルム (*Fusarium oxysporum*) など ; ガエウマンノミュケス属各種 (*Gaeumannomyces species*) 、例えばガエウマンノミュケス・グラミニス (*Gaeumannomyces graminis*) など ; プラスマジオホラ属各種 (*Plasmiodiophora species*) 、例えばプラスマジオホラ・ブラッシカ (*Plasmiodiophora brassicae*) など ; リゾクトニア属各種 (*Rhizoctonia species*) 、例えば、リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) など ; サロクラジウム属各種 (*Sarocladium species*) 、例えばサロクラジウム・オリザ (*Sarocladium oryzae*) など ; スクレロティウム属各種 (*Sclerotium species*) 、例えばスクレロティウム・オリザ (*Sclerotium oryzae*) など ; タペシア属各種 (*Tapesia species*) 、例えばオクリマクラ・タペシア・アクフォルミス (*Tapesia acuformis*) など ; ティエラウィオブシス属各種 (*Thielaviopsis species*) 、例えばティエラウィオブシス・バシコラ (*Thielaviopsis basicola*) など ; に起因する根および茎の疾患。

例えば、アルテルナリア属各種 (*Alternaria species*) 、例えばアルテルナリア属種 (*Alternaria spp.*) など ; アスペルギルス属各種 (*Aspergillus species*) 、例えばアスペルギルス・フラウス (*Aspergillus flavus*) など ; クラドスボリウム属各種 (*Cladosporium species*) 、例えばクラドスボリウム・クラドスボリオイデス (*Cladosporium cladosporioides*) など ; クラヴィケブス属各種 (*Claviceps species*) 、例えばクラヴィケブス・ブルプレア (*Claviceps purpurea*) など ; フサリウム属各種 (*Fusarium species*) 、例えばフサリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*) など ; ギッベレッラ属各種 (*Gibberella species*) 、例えばギッベレッラ・ゼアエ (*Gibberella zea*) など ; モノグラペッラ属各種 (*Monographella species*) 、例えばモノグラペッラ・ニワリス (*Monographella nivalis*) など ; スタゴノスボラ属各種 (*Stagonospora species*) 、例えばスタゴノスボラ・ノドルム (*Stagonospora nodorum*) など ; に起因する (トウモロコシ穂軸を含めた) 穂および円錐花序の疾患。

例えば、スパケロテカ属各種 (*Sphaelotheca species*) 、例えばスパケロテカ・レイリアナ (*Sphaelotheca reiliiana*) など ;

10

20

30

40

50

ティッレティア属各種 (*Tilletia species*)、例えばティッレティア・カリエス (*Tilletia caries*) またはティッレティア・コントロベルサ (*Tilletia controversa*) など; ウロキュステイス属各種 (*Urocystis species*)、例えばウロキュステイス・オックルタ (*Urocystis occulta*) など; ウスティラゴ属各種 (*Ustilago species*)、例えばウスティラゴ・ヌダ (*Ustilago nuda*) など; などの黒穂病菌類 (*smut fungi*) に起因する疾患、

例えば、アスペルギルス属各種 (*Aspergillus species*)、例えばアスペルギルス・フラウス (*Aspergillus flavus*) など; ボトリュティス属各種 (*Botrytis species*)、例えばボトリュティス・キネレア (*Botrytis cinerea*) など; ペニキッリウム属各種 (*Penicillium species*)、例えばペニキッリウム・エクスパンスム (*Penicillium expansum*) またはペニキッリウム・ブルブロゲヌム (*Penicillium purpurogenum*) など; リゾpus属各種 (*Rhizopus species*)、例えばリゾpus・ストロニフェル (*Rhizopus stolonifer*) など; スクレロティニア属各種 (*Sclerotinia species*)、例えばスクレロティニア・スクレロティオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*) など; ウエルティキリウム属各種 (*Verticillium species*)、例えばウェルティキリウム・アルボアトルム (*Verticillium alboatrum*) など; に起因する果実腐敗、

例えば、アルテルナリア属各種 (*Alternaria species*)、例えばアルテルナリア・ブラッシキコラ (*Alternaria brassicicola*) など; アパノミュケス属各種 (*Aphanomyces species*)、例えばアパノミュケス・エウテイケス (*Aphanomyces euteiches*) など; アスコキュタ属各種 (*Ascochyta species*)、例えばアスコキュタ・レンティス (*Ascochyta lentis*) など; アスペルギルス属各種 (*Aspergillus species*)、例えばアスペルギルス・フラウス (*Aspergillus flavus*) など; クラドスボリウム属各種 (*Cladosporium species*)、例えばクラドスボリウム・ヘルバルム (*Cladosporium herbarium*) など; コクリオボルス属各種 (*Cochliobolus species*)、例えばコクリオボルス・サティウス (*Cochliobolus sativus*) (分生子形態: ドレクスレラ (*Drechslera*)、ビポラリス (*Bipolaris*) syn: ヘルミントスボリウム (*Helminthosporium*)) など; コッレトトリクム属各種 (*Colletotrichum species*)、例えばコッレトトリクム・コッコデス (*Colletotrichum coccodes*) など; フサリウム属各種 (*Fusarium species*)、例えばフサリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*) など; ギッベレッラ属各種 (*Gibberella species*)、例えばギッベレッラ・ゼアエ (*Gibberella zeae*) など; マクロボミナ属各種 (*Macrophomina species*)、例えばマクロボミナ・パセオリナ (*Macrophomina phaseolina*) など; ミクロドキウム属各種 (*Microdochium species*)、例えばミクロドキウム・ニバル (*Microdochium nivale*) など; モノグラペッラ属各種 (*Monographella species*)、例えばモノグラペッラ・ニワリス (*Monographella nivalis*) など; ペニキッリウム属各種 (*Penicillium species*)、例えばペニキッリウム・エクスパンスム (*Penicillium expansum*) など; ポマ属各種 (*Phoma species*)、例えばポマ・リンガム (*Phoma lingam*) など; ポモプシス属各種 (*Phomopsis species*)、例えばポモプシス・ソイヤエ (*Phomopsis sojae*) など; ピュトプラ属各種 (*Phytophthora species*)、例えばピュトプラ・カクトルム (*Phytophthora cactorum*) など;

10

20

30

40

50

m)など；ピュレノポラ属各種(*Pyrenophora species*)、例えばピュレノポラ・グラミネア(*Pyrenophora graminea*)など；ピュリクラリア属各種(*Pyricularia species*)、例えばピュリクラリア・オリュザエ(*Pyricularia oryzae*)など；ピュティウム属各種(*Pythium species*)、例えばピュティウム・ウルティムム(*Pythium ultimum*)など；リゾクトニア属各種(*Rhizoctonia species*)、例えばリゾクトニア・ソラニ(*Rhizoctonia solani*)など；リゾpus属各種(*Rhizophorus species*)、例えばリゾpus・オリュザエ(*Rhizophorus oryzae*)など；スクレロティウム属各種(*Sclerotium species*)、例えばスクレロティウム・ロルフシイ(*Sclerotium rolfsii*)など；セプトリア属各種(*Septoria species*)、例えばセプトリア・ノドルム(*Septoria nodorum*)など；テュプラ属各種(*Typehula species*)、例えばテュプラ・インカルナタ(*Typehula incarnata*)など；ウェルティキッリウム属各種(*Verticillium species*)、例えばウェルティキッリウム・ダリアエ(*Verticillium dahliae*)など；に起因する種子および土壤媒介の腐敗病および萎凋病、ならびにさらに実生の疾患。

例えば、ネクトリア属各種(*Nectria species*)、例えばネクトリア・ガッリゲナ(*Nectria galligena*)など；に起因する癌性疾患、虫こぶおよびてんぐ巣病、20

例えば、モニリニア属各種(*Monilinia species*)、例えばモニリニア・ラクサ(*Monilinia laxa*)など；に起因する萎凋病、20

例えば、エキソバシジウム属各種(*Exobasidium species*)、例えばエキソバシジウム・ベキサムス(*Exobasidium vexans*)など；タブリナ属各種(*Taphrina species*)、例えばタブリナ・デフォルマンス(*Taphrina deformans*)など；に起因する葉、花および果実の変形、30

例えば、エスカ属各種(*Esca species*)、例えばファエオモニエラ・クラミドスボラ(*Phaeomonella chlamydospora*)、パエオアケレモニウム・アレオピルム(*Phaeoacremonium aleophilum*)またはフォミティポリア・メディテッラネア(*Fomitiporia mediterranea*)など；ガノデルマ属各種(*Ganoderma species*)、例えばガノデルマ・ボニネンス(*Ganoderma boninense*)など；に起因する木本の変性疾患、30

例えば、ボトリュティス属各種(*Botrytis species*)、例えばボトリュティス・キネレア(*Botrytis cinerea*)など；に起因する花および種子の疾患、40

例えば、リゾクトニア属各種(*Rhizoctonia species*)、例えばリゾクトニア・ソラニ(*Rhizoctonia solani*)など；ヘルミントスボリウム属各種(*Helminthosporium species*)、例えばヘルミントスボリウム・ソラニ(*Helminthosporium solani*)など；に起因する植物塊茎の疾患、40

例えば、クサントモナス属各種(*Xanthomonas species*)、例えばクサントモナス・カムペストリス p.v. オリュザエ(*Xanthomonas campestris p.v. oryzae*)など；プセウドモナス属各種(*Pseudomonas species*)、例えばプセウドモナス・シュリンガエ p.v. ラクリュマンス(*Pseudomonas syringae p.v. lachrymans*)など；エルウィニア属各種(*Erwinia species*)、例えばエルウィニア・アミュロウォラ(*Erwinia amylovora*)など；などの細菌性病原体に起因する疾患。

大豆の以下疾患の防除が好ましい。

【0130】

例えば、アルテルナリア斑点病（アルテルナリア属種アトランス・テヌイシッマ（*Alternaria spec. atrans tenuissima*））、炭疽病（コツレトリクム・グロエオスポロイデス デマチウムvar. トルンカツム（*Colletotrichum gloeosporoides dematum var. truncatum*））、褐斑病（セプトリア・グリュキネス（*Septoria glycines*））、ケルコスpora斑点病および胴枯病（ケルコスpora・キクキイ（*Cercospora kikuchii*））、コアネpora葉枯病（コアネpora・インフンディブリフェラ・トリスピラ（*Choanephora infundibulifera trispora*）（Syn.））、ダクトウリオpora斑点病（ダクトウリオpora・グリュキネス（*Dactuliophora glycines*））、ベト病（ペロノスpora・マンシリカ（*Peronospora manshurica*））、ドレクスレラ胴枯病（ドレクスレラ・グリュキニ（*Drechslera glycini*））、赤星斑点病（ケルコスpora・ソイナ（*Cercospora sojina*））、レプトスパエルリナ斑点病（レプトスパエルリナ・トリフォリイ（*Leptosphaerulina trifoliae*））、ピュッロスティクタ斑点病（ピュッロスティクタ・ソイヤエコラ（*Phyllosticta sojaecola*））、さやおよび茎の胴枯病（ポモブシス・ソイヤエ（*Phomopsis sojae*））、うどんこ病（ミクロスパエラ・ディッフサ（*Microsphaera diffusa*））、ピュレノカエタ斑点病（ピュレノカエタ・グリュキネス（*Pyrenopeziza glycines*））、リゾクトニア葉胴枯病（リゾクトニア・ソラニ（*Rhizoctonia solani*））、さび病（パコプソラ・パキュリジ（*Phakopsora pachyrhizi*））、パコプソラ・メイボミアエ（*Phakopsora meibomiae*）、黒星病（スパケロマ・グリュキネス（*Sphaeloma glycines*））、ステムピュリウム葉枯病（ステムピュリウム・ボトリュオスム（*Stemphylium botrys*））、輪紋病（コリュネスpora・カッシイコラ（*Corynespora cassiicola*））に起因する葉、茎、さやおよび種子上の真菌性疾患。

【0131】

例えば、黒根腐病（カロネクトリア・クロタラリアエ（*Calonectria crotalariae*））、炭腐病（マクロボミナ・パセオリナ（*Macrophomina phaseolina*））、フサリウム胴枯病または萎凋病、根腐病、ならびにさや腐病および頸領腐病（フサリウム・オクシスポルム（*Fusarium oxysporum*）、フサリウム・オルトケラス（*Fusarium orthoceras*）、フサリウム・セミテクトウム（*Fusarium semitecum*）、フサリウム・エクワイセティ（*Fusarium equiseti*））、ミュコレプトディスクス根腐病（ミュコレプトディスクス・テッレストリス（*Mycrocoleptodiscus terrestris*））、根腐病（ネオコスマスpora・ワシンフェクタ（*Neocosmospora vasinfecta*））、さやおよび茎の胴枯病（ディアポルテ・パセオロルム（*Diaporthe phaseolorum*））、茎がん腫病（ディアポルテ・パセオロルムvar. カウリボラ（*Diaporthe phaseolorum var. caulinivora*））、ピュトプトラ腐れ病（ピュトプトラ・メガスペルマ（*Phytophthora megasperma*））、落葉病（ピアロpora・グレガタ（*Phialophora gregata*））、ピュティウム腐れ病（ピュティウム・アパニデルマトウム（*Pythium aphanidermatum*）、ピュティウム・イッレグラレ（*Pythium irregularare*）、ピュティウム・デバリュヌム（*Pythium debaryanum*）、ピュティウム・ミユリオテュルム（*Pythium myriotylum*）、ピュティウム・ウルティムム（*Pythium ultimum*））、リゾクトニア根腐病、茎腐朽病および立ち枯れ病（リゾクトニア・ソラニ（*Rhizoctonia solani*））、スクレロティニア茎腐朽病（ス

クレロティニア・スクレロティオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*))、スクレロティニア白絹病 (スクレロティニア・ロルフシイ (*Sclerotinia rolfsii*))、ティエラウィオプシス根腐病 (ティエラウィオプシス・バシコラ (*Thielaviopsis basicola*)) に起因する根および茎基部上の真菌性疾患。

【0132】

本発明による活性化合物は、植物において強力な賦活化作用も示す。すなわち、これらは、望まれない微生物による攻撃に対して植物の内部防御を動員するのに適当である。

【0133】

本文脈において、植物賦活化（抵抗性誘発）物質は、処理される植物が望まれない微生物を引き続いて接種されると、これらの微生物に対して実質的な抵抗性を示すような植物の防御系を刺激する能力がある物質を意味すると理解されるべきである。10

【0134】

本事例において、望ましくない微生物は、植物病原性真菌および細菌を意味すると理解されるべきである。したがって、本発明による物質は、処理後一定の期間内で上述の病原体による攻撃から植物を保護するために用いることができる。これらの保護が有効である期間は、一般に、植物が活性化合物で処理された後 1 日から 10 日、好ましくは 1 日から 7 日に及ぶ。

【0135】

活性化合物が植物病の防除に必要な濃度で植物に非常に忍容性があるという事実により、地上の植物部位、栄養繁殖器官および種子、ならびに土壤の処理が可能になる。20

【0136】

この文脈において、本発明による活性化合物は、例えば特にベト病真菌、卵菌類 (*Oomycetes*)、例えばピュトプラ (*Phytophthora*)、プラスモバラ (*Plasmopara*)、ブセウドペロノスポラ (*Pseudoperonospora*) およびピュティウム属各種 (*Pythium species*) など、ブドウ栽培ならびに果実、ジャガイモおよび野菜の栽培における疾患を防除するのに特に成功裏に用い得る。

【0137】

本発明による活性化合物は、収量を増加させるのにも適当である。さらに、これらは低い程度の毒性を示し、植物に非常に忍容性がある。30

【0138】

適切な場合、本発明による化合物は、特定の濃度または施用量で、除草剤、安全化剤、成長調節剤もしくは植物の特性を改善させる薬剤として、または殺菌剤、例えば殺真菌剤、抗糸状菌剤、殺菌剤、殺ウイルス剤（ウイロイドに対する薬剤を含める。）として、またはMLO（マイコプラズマ様生物体）およびRLO（リケッチア様生物体）に対する薬剤として使用することもできる。適切な場合、これらは殺虫剤として用いることもできる。適切な場合、これらは他の活性化合物の合成のための中間体または前駆体として用いることもできる。

【0139】

本発明による活性化合物は、温血動物に良好な植物耐性および有利な毒性とならびに環境に非常に忍容性との組合せにおいて、植物および植物器官を保護し、収穫率を増加させ、ならびに農業、園芸、畜産、森林、庭園およびレジャー施設、貯蔵製品および材料の保護ならびに衛生部門における収穫材料の品質を改善するのに適当である。これらは、作物保護剤として用いるのが好ましい。これらは、通常感受性および耐性の種、ならびに成長の全てまたは一部の段階で活性である。40

【0140】

該活性化合物または組成物を用いる植物および植物部位の本発明による処理は通例の処理方法を使用して、例えば、浸漬、スプレー、噴霧、灌漑、蒸発、散粉、煙霧、散布、発泡、塗装、拡散、撒水（浸水）、点滴灌漑、および繁殖材料の場合、特に種子の場合さら

10

20

30

40

50

に乾燥種子処理用の粉末、湿式種子処理用溶液、スラリー処理用水 - 水溶剤として、外被化、1つ以上の外被でのコーティングなどにより、直接、またはこれらの周囲、生息地もしくは貯蔵空間への措置によって実施される。超低量方法によって該活性化合物を施用すること、または該活性化合物製剤もしくは活性化合物自体を土壤中に注入することもさらに可能である。

【0141】

材料の保護において、本発明による組成物または活性化合物はさらに、例えば真菌などの望まれない微生物による攻撃および破壊に対して産業材料を保護するために使用することができる。

【0142】

本文脈において、産業材料は、科学技術における使用のために作製された非生物材料を意味すると理解されるべきである。例えば、本発明による活性化合物によって微生物による改変または破壊から保護されるべき産業材料は、接着剤、サイズ剤、紙および板、織物、なめし革、材木、ペンキおよびプラスチック物品、冷却潤滑剤、ならびに微生物によって攻撃または破壊される可能性がある他の材料であり得る。生産プラントの一部、例えば、微生物の増殖によって不利に影響される冷却水回路も、保護するべき材料の中に挙げることができる。本発明の目的のために好ましく挙げができる産業材料は、接着剤、サイズ剤、紙および板、なめし革、材木、ペンキ、冷却潤滑剤ならびに熱伝達流体、特に好ましくは材木である。本発明による組成物または活性化合物は、腐敗、腐朽、変色、脱色、またはカビの形成などの不利な影響を防止することができる。

10

20

30

40

50

【0143】

望まれない真菌を防除するための本発明による方法は、貯蔵品を保護するために使用することもできる。本明細書において、貯蔵品は、野菜もしくは動物由来の天然物質、または長期保護が望ましい天然由来のこれらの加工製品を意味すると理解されるべきである。野菜由来、例えば茎、葉、塊茎、種子、果実、子実などの植物または植物部位の貯蔵品は、収穫したてに、または(予備)乾燥、湿潤、粉末化、粉碎、加圧もしくは焙煎することによって加工した後に保護することができる。貯蔵品として、建築材木、電柱および防壁などの未加工の材木、または家具などの最終製品の形態における材木の両方を挙げることもできる。動物由来の貯蔵品は、例えば皮革、なめし革、毛皮および毛髪である。本発明による活性化合物は、腐敗、腐朽、変色、脱色、またはカビの形成などの不利な影響を防止することができる。

【0144】

挙げができる、産業材料を劣化または変化させる可能性がある微生物は、例えば細菌、真菌、酵母、藻類および粘液生物である。本発明による活性化合物は、好ましくは、真菌、特にカビ、木材変色および木材破壊真菌(担子菌類(*Basidiomycetes*))、ならびに粘液生物および藻類に対して作用する。以下の属の微生物を例として挙げができる。アルテルナリア・テヌイス(*Alternaria tenuis*)などのアルテルナリア(*Alternaria*)；アスペルギルス・ニゲル(*Aspergillus niger*)などのアスペルギルス(*Aspergillus*)；カエトミウム・グロボスム(*Chaetomium globosum*)などのカエトミウム(*Chaetomium*)；コニオホラ・プエタナ(*Coniophora puteana*)などのコニオホラ(*Coniophora*)；レンチヌス・チグリヌス(*Lentinus tigrinus*)などのレンチヌス(*Lentinus*)；ペニキッリウム・グラウクム(*Penicillium glaucum*)などのペニキッリウム(*Penicillium*)；ポリポルス・ベルシコロル(*Polyporus versicolor*)などのポリポルス(*Polyporus*)；アウレオバシジウム・ブルランス(*Aureobasidium pullulans*)などのアウレオバシジウム(*Aureobasidium*)；スクレロホマ・ピチオフィラ(*Sclerophoma pityophila*)などのスクレロホマ(*Sclerophoma*)；トリコデルマ・ビリド(*Trichoderma viride*)などのトリコデルマ(*Trich*

oderma) ; エスケリキア・コリ (*Escherichia coli*) などのエスケリキア (*Escherichia*) ; プセウドモナス・アエルギノサ (*Pseudomonas aeruginosa*) などのプセウドモナス (*Pseudomonas*) ; スタフィルオコックス・アウロイス (*Staphylococcus aureus*) などのスタフィルオコックス (*Staphylococcus*)。

【0145】

本発明はさらに、本発明によるチアゾリルオキシムエーテルおよびヒドラゾンの少なくとも1種を含む、望まれない微生物を防除するための組成物に関する。これらは、農業における使用に適当な助剤、溶媒、担体、界面活性剤または增量剤を含む殺真菌性組成物であるのが好ましい。

10

【0146】

本発明によると、担体は、より良好な施用、特に植物もしくは植物の一部または種子への施用のために該活性化合物を混合または結合する天然または合成の有機物または無機物である。固体または液体であってよい担体は一般に不活性であり、農業における使用に適当であるべきである。

20

【0147】

適当な固体担体は、例えば、アンモニウム塩、およびカオリン、粘土、タルク、チヨーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイトまたは珪藻土などの粉碎天然鉱物、ならびに微粉シリカ、アルミナおよびシリケートなどの粉碎合成鉱物であり、顆粒に適当な固体担体は、例えば、方解石、大理石、軽石粉、海泡石およびドロマイトなど破碎および画分化された天然岩、ならびにさらに無機および有機荒粉の合成顆粒、ならびに紙、おがくず、ココナツ外殻、トウモロコシ穂軸およびタバコ柄などの有機材料の顆粒であり、適当な乳化剤および／または泡形成剤は、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、アルキルスルホネート、アルキルサルフェート、アリールスルホネートなど非イオン性およびアニオン性の乳化剤、ならびにさらにタンパク質加水分解物であり、適当な分散剤は、例えば、アルコール／POEおよび／もしくはPOPエーテル、酸および／もしくはPOP／POEエステル、アルキルアリールおよび／もしくはPOP／POEエーテル、脂肪および／もしくはPOP／POE付加物、POEおよび／もしくはPOPポリオール誘導体、POEおよび／もしくはPOP／ソルビタンもしくは糖付加物、アルキルサルフェートもしくはアリールサルフェート、アルキルスルホネートもしくはアリールスルホネートおよびアルキルホスフェートもしくはアリールホスフェート、または対応するPOエーテル付加物の部類由来の非イオン性および／またはイオン性物質である。

30

【0148】

さらに適当なオリゴマーまたはポリマーは、例えば、ビニルモノマー、アクリル酸、EOおよび／もしくはPO単独から、または例えば(ポリ)アルコールまたは(ポリ)アミンとの組合せで誘導されたものである。リグニンおよびこのスルホン酸誘導体、非修飾および修飾セルロース、芳香族および／または脂肪族スルホン酸、ならびにホルムアルデヒドとのこれらの付加物を用いることも可能である。

40

【0149】

該活性化合物は、溶液、エマルジョン、水和剤、水性および油性懸濁液、散剤、粉剤、ペースト剤、水溶剤、溶解性顆粒、散布用顆粒、懸濁乳剤、活性化合物に含浸させた天然材料、活性化合物に含浸させた合成材料、肥料、ならびにさらにポリマー物質中のマイクロカプセル化物などの通例の製剤に変換することができる。

【0150】

該活性化合物は、使用準備済の溶液、エマルジョン、水性または油性懸濁液、散剤、水和剤、ペースト剤、水溶剤、粉剤、溶解性顆粒、散布用顆粒、懸濁乳剤、活性化合物に含浸させた天然材料、活性化合物に含浸させた合成材料、肥料、およびさらにポリマー物質中のマイクロカプセル化物など、これらの製剤の形態、またはこれから調製した使用形態で使用することができる。施用は、通例の方法、例えば注流、スプレー、噴霧、散布、

50

散粉、発泡、塗装などによって実施される。超低量方法により該活性化合物を施用すること、または該活性化合物の調製物もしくは該活性化合物自体を土壤に注入することもさらに可能である。植物の種子を処理することも可能である。

【0151】

挙げられた製剤は、それ自体知られている方法で、例えば、少なくとも1種の通例の增量剤、溶媒または希釈剤、乳化剤、分散剤および／またはバインダーもしくは固定液、湿润剤、撥水剤、適切な場合乾燥剤およびUV安定剤、および適切な場合着色剤および顔料、消泡剤、保存料、二次増粘剤、接着剤、ジベレリン、ならびに他の処理助剤と該活性化合物を混合することによって調製することができる。

【0152】

本発明による組成物は、既に使用する準備がされおり、適当な装置を使用して植物または種子に施用することができる製剤だけでなく、使用前に水で希釈しなければならない市販の濃縮物も含まれる。

【0153】

本発明による活性化合物は、このように、またはこれらの（市販の）製剤中に、ならびにさらに殺虫剤、誘引剤、滅菌剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺真菌剤、成長調節剤、除草剤、肥料、安全化剤および／もしくはセミオケミカルなど他の（公知）活性化合物との混合物として、これらの製剤から調製される使用形態で存在することができる。

【0154】

助剤として使用するのに適当なものは、該組成物自体および／またはこれらから誘導された調製物（例えば、スプレー液、種子粉衣剤）に特定の技術特性および／またはさらに特別な生物学的特性などの特別な特性を付与するのに適当である物質である。代表的な適当な助剤は、增量剤、溶媒および担体である。

【0155】

適当な增量剤は、例えば水、例えば芳香族および非芳香族の炭化水素（パラフィン、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、クロロベンゼンなど）、アルコールおよびポリオール（適切な場合、置換、エーテル化および／またはエステル化されていてよい。）、ケトン（アセトン、シクロヘキサンなど）、エステル（脂肪および油を含める。）および（ポリ）エーテル、非置換および置換のアミン、アミド、ラクタム（N-アルキルピロリドンなど）およびラクトン、スルホンおよびスルホキシド（ジメチルスルホキシドなど）の部類由来の極性および非極性の有機化学液体である。

【0156】

液化されたガス状增量剤または担体は、周囲温度および大気圧下でガス状である液体、例えば、ハロゲン化炭化水素、ならびにさらにブタン、プロパン、窒素および二酸化炭素などのエアゾール噴霧剤である。

【0157】

アラビアゴム、ポリビニルアルコール、ポリ酢酸ビニル、または他にケファリンおよびレシチンならびに合成リン脂質などの天然リン脂質など、散剤、顆粒およびラテックスの形態における、カルボキシメチルセルロースならびに天然および合成ポリマーなどの粘着性付与剤は、製剤中に使用することができる。他の可能な添加剤は、鉱物油および植物油である。

【0158】

使用される增量剤が水である場合、例えば、補助溶媒として有機溶媒を使用すること也可能である。適当な液体溶媒は本質的に、キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレンなどの芳香族化合物、クロロベンゼン、クロロエチレンまたは塩化メチレンなどの塩素化芳香族化合物または塩素化脂肪族炭化水素、シクロヘキサンまたはパラフィンなどの脂肪族炭化水素、例えば、鉱油留分、ブタノールまたはグリコールなどのアルコール、ならびにこれらのエーテルおよびエステル、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサンなどのケトン、ジメチルホルムアミドおよびジメチルスルホキシドなどの強極性溶媒、ならびにさらに水である。

10

20

30

40

50

【0159】

本発明による組成物は、例えば界面活性剤などのさらなる構成成分を追加として含むことができる。適当な界面活性剤は、イオン性もしくは非イオン性の特性を有する乳化剤および／もしくは泡形成剤、分散剤、もしくは湿潤剤、またはこれらの界面活性剤の混合物である。これらの例は、ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸またはナフタレンスルホン酸の塩、脂肪アルコールまたは脂肪酸または脂肪アミンとエチレンオキシドとの重縮合物、置換フェノール（好ましくは、アルキルフェノールまたはアリールフェノール）、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導体（好ましくは、アルキルタウレート）、ポリエトキシ化アルコールまたはフェノールのリン酸エステル、ポリオールの脂肪エステル、ならびにスルフェート、スルホネートおよびホスフェートを含有する化合物の誘導体、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル、アルキルスルホネート、アルキルサルフェート、アリールスルホネート、タンパク質加水分解物、リグノスルファイト廃液およびメチルセルロースである。界面活性剤の存在は、活性化合物の1種および／または不活性担体の1種が水中で不溶性である場合に必要であり、施用は水中で実施される。界面活性剤の割合は、本発明の組成物の5重量%から40重量%の間である。

10

【0160】

無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタン、ブルシアンブルー、ならびにアリザリン染料、アゾ染料および金属フタロシアニン染料などの有機染料などの着色剤、ならびに鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩など微量の栄養素を使用することができる。

20

【0161】

他の可能な添加剤は、芳香剤、鉱物油または植物油、適切な場合非修飾ワックス、ならびに鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩などの栄養素（微量の栄養素を含める。）である。

【0162】

低温安定剤、保存料、抗酸化剤、光安定剤などの安定剤、または化学的および／もしくは物理的安定性を向上させる他の薬剤も存在し得る。

30

【0163】

適切な場合、他の追加の構成成分、例えば、保護コロイド、バインダー、接着剤、増粘剤、チキソトロピー剤、浸透剤、安定剤、捕捉剤、錯体形成体が存在する可能性もある。一般に、該活性化合物は、製剤の目的に通常使用される任意の固体または液体の添加剤と組み合わせることができる。

【0164】

該製剤は一般に、0.05重量%から99重量%、0.01重量%から98重量%の間、好ましくは0.1重量%から95重量%の間、特に好ましくは0.5重量%から90重量%の間の活性化合物、非常に特に好ましくは10重量%から70重量%の間を含む。

30

【0165】

上記されている製剤は、本発明によるチアゾリルオキシムエーテルおよびヒドラゾンが微生物および／またはこれらの生息地に施用される、望まれない微生物を防除するための本発明による方法で用いることができる。

40

【0166】

これ自体またはこれらの製剤における本発明による活性化合物は、例えば活性スペクトルを拡大するため、または抵抗性の発生を防止するため、公知の殺真菌剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫または殺虫剤との混合物中に使用することもできる。

【0167】

適当な混合相手は、例えば、公知の殺真菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、または他に殺菌剤である（Pesticide Manual、第13版も参照のこと。）。

【0168】

除草剤などの他の公知活性化合物または肥料および成長調節剤、安全化剤および／もし

50

くはセミオケミカルとの混合物も可能である。

【0169】

施用は使用形態に適合した方法で実施される。

【0170】

本発明はさらに、種子を処理する方法も含む。

【0171】

本発明のさらなる態様は、特に、本発明によるチアゾリルオキシムエーテルおよびヒドラゾンの少なくとも1種で処理された種子に関する。本発明による種子は、植物病原性の有害な真菌に対して種子を保護するための方法に使用される。これらの方法において、本発明による少なくとも1種の活性化合物で処理された種子が使用される。

10

【0172】

本発明による組成物および活性化合物は、種子を処理するのにも適当である。有害生物によって引き起こされる作物植物への損傷の大部分は、種子が貯蔵中に攻撃される時、または種子が土壤中に導入された後に生じ、植物の発芽中および発芽後にも生じる。成長中の植物の根および苗条が特に敏感であり、軽い損傷でも植物の死に至る恐れがあるため、この段階は特に重要である。適当な組成物の使用により種子および発芽中の植物を保護することは、したがって、大きな興味対象である。

【0173】

植物の種子を処理することによる植物病原性の有害な真菌の防除は長い間知られており、継続的改善の対象である。しかし、種子の処理において、常に満足のいく方法で解決できるわけではない多くの問題に直面する。したがって、播種後もしくは植物の発生後の作物保護剤の追加施用を省く、または追加施用が少なくとも著しく低減される、種子および発芽中の植物を保護するための方法を開発するのが望ましい。植物病原性真菌による攻撃から種子および発芽中の植物に最大保護を提供するが、用いられる活性化合物により植物自体を損傷することがない方法で用いられる活性化合物の量を最適化することがさらに望ましい。特に、種子の処理のための方法には、最小の作物保護剤を用いて種子および発芽中の植物の最適な保護を達成するために、トランスジェニック植物の固有の殺真菌特性も考慮するべきである。

20

【0174】

本発明はしたがって、本発明の組成物で種子を処理することによって動物有害生物および/または植物病原性の有害な真菌による攻撃から種子および発芽中の植物を保護するための方法にも関する。本発明は同様に、植物病原性真菌から種子および発芽中の植物を保護するための、種子を処理するための本発明による組成物の使用に関する。さらに、本発明は、植物病原性真菌からの保護を可能にするための、本発明の組成物で処理された種子に関する。

30

【0175】

発生後の植物を損傷する動物有害生物および/または植物病原性の有害な真菌は、作物保護剤で土壤および植物の地上部を処理することによって主に防除される。環境ならびにヒトおよび動物の健康に対する作物保護剤の起こり得る影響に関する懸念のため、施用される活性化合物の量を低減する取組みがある。

40

【0176】

本発明の利点の1つは、本発明による組成物の特有な浸透移行特性が、これらの組成物で種子を処理することにより種子自体だけでなく発生後のその植物も動物有害生物および/または植物病原性の有害な真菌から保護することを意味することである。この方法では、播種時またはその直後の作物の即時処理を省くことができる。

【0177】

本発明による組成物および活性化合物は、この種子から成長する植物が、有害生物に対して作用するタンパク質を発現する能力がある特にトランスジェニック種子のためにも使用することができることも有利であると考えられるべきである。本発明による組成物および活性化合物でこうした種子を処理することによって、例えば殺虫性タンパク質の発現に

50

よるだけで特定の有害生物を防除することができる。驚くべきことに、有害生物による攻撃に対する保護の有効性をさらに改善するさらなる相乗作用の効果が、本発明において認めることができる。

【0178】

本発明による組成物は、農業、温室、森林または園芸において用いられるあらゆる植物品種の種子を保護するのに適当である。特に、これは、穀類（コムギ、オオムギ、ライムギ、アワおよびカラスムギなど）、トウモロコシ、綿、大豆、イネ、ジャガイモ、ヒマワリ、マメ、コーヒー、ビート（例えば、サトウダイコンおよび飼料用ビート）、ピーナッツ、野菜（トマト、キュウリ、タマネギおよびレタスなど）、芝生および装飾用植物の種子の形態をとる。穀類（コムギ、オオムギ、ライムギおよびカラスムギなど）、トウモロコシおよびイネの種子の処理は特に重要である。

10

【0179】

下記にも記載されている通り、本発明による組成物または活性化合物を用いるトランスジェニック種子の処理は特に重要である。これは、殺虫特性を持つポリペプチドまたはタンパク質の発現を可能にする少なくとも1種の異種遺伝子を含む植物の種子の形態をとる。トランスジェニック種子における該異種遺伝子は、例えばバキルルス（*Bacillus*）、リゾビウム（*Rhizobium*）、プセウドモナス（*Pseudomonas*）、セッラティア（*Serratia*）、トリコデルマ（*Trichoderma*）、クラウイバクテル（*Clavibacter*）、グロムス（*Gloomus*）またはグリオクラディウム（*Gliocladium*）種の微生物に由来し得る。この異種遺伝子はバキルルス属種（*Bacillus* spp.）が起源であるのが好ましく、該遺伝子産物は、ヨーロッパアワノメイガおよび／または西洋コーンルートワームに対する活性を有する。バキルルス・トウリンギエンシス（*Bacillus thuringiensis*）から由来の異種遺伝子が特に好ましい。

20

【0180】

本発明の文脈において、本発明の組成物は、単独または適当な製剤のいずれかで種子に施用される。好ましくは、種子は、処理中の損傷を回避するのに十分安定である状態で処理される。一般に、種子は、収穫から播種の間の任意の時点で処理することができる。通常使用される種子は植物から分離されており、果実の穂軸、外殻、柄、外被、毛または果肉を取り除かれている。したがって、例えば、収穫され、汚れを落とし、含水量が15重量%未満まで乾燥させた種子を使用することが可能である。別法として、乾燥させた後、例えば、水で処理し、次いで再び乾燥させた種子を使用することも可能である。

30

【0181】

種子を処理する場合、一般に種子に施用される本発明の組成物の量および／またはさらなる添加剤の量は、種子の発芽が不利に影響されない方法、または生じる植物が損傷されない方法で選択されるように配慮されなければならない。これは、特定の施用量において植物毒性作用を有する恐れがある活性化合物の場合、特に留意しなければならない。

【0182】

本発明による組成物は、直接、すなわちさらなる構成成分を含むことなく、希釈されることなく施用することができる。一般に、適当な製剤の形態で種子に該組成物を施用することができる。種子を処理するための適当な製剤および方法は当業者に知られており、例えば以下の文献に記載されている。US 4,272,417 A、US 4,245,432 A、US 4,808,430 A、US 5,876,739 A、US 2003/0176428 A1、WO 2002/080675 A1、WO 2002/028186 A2。

40

【0183】

本発明に従って使用することができる活性化合物は、溶液、エマルジョン、懸濁液、散剤、フォーム、スラリーまたは種子用の他のコーティング材料など通例の種子粉衣製剤、およびさらにULV製剤に変換することができる。

【0184】

50

これらの製剤は、該活性化合物を混合することによって、または例えば通例の増量剤およびさらに溶媒もしくは希釈剤、着色剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、保存料、二次増粘剤、粘着剤、ジベレリンならびにさらに水などの通例の添加剤との活性化合物の組合せを混合することによって、公知方法で調製される。

【0185】

本発明に従って使用することができる種子粉衣製剤中に存在してよい適当な着色剤には、こうした目的に通例の全ての着色剤が含められる。水に弱溶解性の顔料、および水に溶解性である染料の両方を使用することができる。挙げることができる例には、ローダミンB、C.I.Pigment Red 112およびC.I.Solvent Red 1の称号の下で知られている着色剤が含められる。

10

【0186】

本発明に従って使用することができる種子粉衣製剤中に存在してよい適当な湿潤剤には、湿潤を向上し、活性農薬化合物の製剤中に通例である全ての物質が含められる。好ましくは、ジイソプロピルナフタレンスルホネートまたはジイソブチルナフタレンスルホネートなどのアルキルナフタレンスルホネートを使用することが可能である。

【0187】

本発明に従って使用することができる種子粉衣製剤中に存在してよい適当な分散剤および/または乳化剤には、活性農薬化合物の製剤中に通例である全ての非イオン性、アニオン性およびカチオン性の分散剤が含められる。好ましくは、非イオン性もしくはアニオン性の分散剤、または非イオン性もしくはアニオン性の分散剤の混合物を使用することが可能である。特に適当な非イオン性分散剤は、エチレンオキシド-プロピレンオキシドブロックポリマー、アルキルフェノールポリグリコールエーテルおよびトリスチリルフェノールポリグリコールエーテル、ならびにこれらのリン酸化誘導体または硫酸化誘導体である。特に適当なアニオン性分散剤は、リグノスルホネート、ポリアクリル酸塩およびアリールスルホネートホルムアルデヒド縮合物である。

20

【0188】

本発明に従って使用することができる種子粉衣製剤中に存在してよい適当な消泡剤には、活性農薬化合物の製剤に通例である全ての泡状物質阻害物質が含められる。好ましくは、シリコーン消泡剤およびステアリン酸マグネシウムを使用することが可能である。

30

【0189】

本発明に従って使用することができる種子粉衣製剤中に存在してよい適当な保存料には、農薬組成物においてこうした目的に使用することができる全ての物質が含められる。例として、ジクロロフェンおよびベンジルアルコールヘミホルマールを挙げることができる。

【0190】

本発明に従って使用することができる種子粉衣製剤中に存在してよい適当な二次増粘剤には、農薬組成物においてこうした目的に使用することができる全ての物質が含められる。好ましい適合性は、セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサンタン、改質粘土および微粉シリカによって保有される。

【0191】

本発明に従って使用することができる種子粉衣製剤中に存在してよい適当な粘着剤には、種子粉衣剤に使用することができる全ての通例のバインダーが含められる。好ましくは、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコールおよびチロースを挙げることができる。

40

【0192】

本発明に従って使用することができる種子粉衣製剤中に存在してよい適当なジベレリンは、ジベレリンA1、A3(=ジベレリン酸)、A4およびA7が好ましく、特に好ましくはジベレリン酸が使用される。ジベレリンは公知である(R.Wegler「Chemie der Pflanzenschutz- und Schadlingsbekämpfungsmittel」、第2巻、Springer Verlag、1970、

50

401 - 412 頁参照)。

【0193】

本発明に従って使用することができる種子粉衣製剤は、直接または事前に水で希釈した後のいずれかで使用され、非常に広範な様々な種類の任意の種子を処理することができる。例えば、濃縮物、または水で希釈することによってこれらから得られる調製物は、コムギ、オオムギ、ライムギ、カラスムギおよびライコムギなどの穀類の種子、ならびにさらにトウモロコシ、イネ、アブラナ、エンドウマメ、フィールドビーン、綿、ヒマワリのおよびテンサイの種子、または他に非常に広範な様々な種類の任意の野菜種子を粉衣するために使用することができる。本発明に従って使用することができる種子粉衣製剤またはこれらの希釈調製物は、トランスジェニック植物の種子を粉衣するために使用することができる。この文脈において、追加の相乗作用の効果は、発現によって形成される物質との相互作用において生じることもある。

10

【0194】

本発明に従って使用することができる種子粉衣製剤、または水を添加することによってこれらから調製される調製物で種子を処理するための適当な混合装置には、粉衣のために通常使用することができる全ての混合装置が含められる。粉衣する場合に採用される具体的な手順は、混合装置に種子を導入すること、特定の所望量の種子粉衣製剤をそのまま、または事前に水で希釈した後に添加すること、および製剤が種子上に均一に分散されるまで混合を実施することを含む。必要に応じて、乾燥作業が後に続く。

20

【0195】

本発明に従って使用することができる種子粉衣製剤の施用量は、比較的広い範囲内で変動してよい。これは、製剤における活性化合物のそれぞれの含有量および種子に依存する。一般に、活性化合物組合せの施用量は、種子 1 キログラム当たり 0.001 g から 50 g の間、好ましくは種子 1 キログラム当たり 0.01 g から 15 g の間である。

【0196】

さらに、本発明による式(I)の化合物は、非常に良好な抗糸状菌活性も有する。これらは、特に皮膚糸状菌および酵母、カビならびに二相性真菌に対する非常に広い抗糸状菌活性スペクトルを有する(例えば、カンジダ・アルビカンス(*Candida albicans*)、カンジダ・グラブラタ(*Candida glabrata*)およびエピデルモフィトン・フロッコスマ(*Epidemophyton floccosum*)などのカンジダ属各種、アスペルギルス・ニゲル(*Aspergillus niger*)およびアスペルギルス・フミガトウス(*Aspergillus fumigatus*)などのアスペルギルス属各種(*Aspergillus species*)、トリコフィトン・メンタグロフィテス(*Trichophyton mentagrophytes*)などのトリコフィトン属各種(*Trichophyton species*)、ミクロスボロン・カニス(*Microsporon canis*)およびアウドウイニイ(*audouinii*)などのミクロスボロン属各種(*Microsporon species*)に対する。)。これらの真菌の一覧は、対象とされ得る糸状菌スペクトルを限定するものではなく、単に例示のためである。

30

【0197】

すなわち、本発明による式(I)の活性化合物は、医療施用および非医療施用の両方に使用することができる。

40

【0198】

活性化合物はこうして、これらの製剤の形態、または使用準備済の溶液、懸濁液、水和剤、ペースト剤、水溶剤、粉剤および顆粒など、これらから調製される使用形態で施用することができる。施用は、通例の方法、例えば撒水、スプレー、噴霧、散布、散粉、発泡、塗装などをすることによって実施される。超低量方法によって活性化合物を施用すること、または活性化合物の調製物もしくは活性化合物自体を土壤に注入することも可能である。植物の種子を処理することも可能である。

【0199】

50

本発明による活性化合物を殺真菌剤として使用する場合、施用量は、施用の種類に依存して比較的広い範囲内で変動し得る。本発明による活性化合物の施用量は以下の通りである。

【0200】

・植物の一部の処理において、例えば、葉：0.1 g / ha から 10000 g / ha 、好ましくは 10 g / ha から 1000 g / ha 、特に好ましくは 50 g / ha から 300 g / ha (施用が撒水または点滴することによる場合、またさらに、ロックウールまたはパーライトなどの不活性な基質が使用される場合に特に施用量を低減することが可能である。) 、

・種子の処理において、種子 100 kg 当たり 2 g から 200 g 、好ましくは種子 1000 kg 当たり 3 g から 150 g 、特に好ましくは種子 100 kg 当たり 2.5 g から 25 g 、非常に特に好ましくは種子 100 kg 当たり 2.5 g から 12.5 g 、

・土壤処理において、0.1 g から 10000 g / ha 、好ましくは 1 g から 500 g / ha 。

【0201】

これらの施用量は例示的な方法でのみ挙げられており、本発明の目的のために限定するものではない。

【0202】

獣医部門および動物の飼育において、本発明による活性化合物は、例えば錠剤、カプセル、飲料、水薬、顆粒、ペースト剤、ボーラス、飼料を介する方法、坐剤の形態における腸内投与によって、例えば注入（筋肉内、皮下、静脈内、および腹腔内など）、移植片などの非経口投与によって、経鼻施用によって、例えば水浴または浸漬、スプレー、注流およびスポットティング、洗浄、散粉の形態における皮膚施用によって、ならびに首輪、耳標、尾標、肢帶、端綱およびマーキング装置などの活性化合物含有造形品を用いて、公知方法で施用される。

【0203】

家畜、家禽および家庭動物などのために使用される場合、式（I）の活性化合物は、1重量%から80重量%の量で直接または100倍から10000倍に希釈後のいずれかで該活性化合物を含む製剤（例えば、散剤、エマルジョン、フロアブル剤）として、または他に化学浴として施用することができる。

【0204】

適切な場合、使用準備済組成物は、さらなる殺虫剤、および適切な場合1つ以上のさらなる殺真菌剤を含むことができる。

【0205】

可能な追加の混合相手に関し、上述した殺虫剤および殺真菌剤を参照とする。

【0206】

本発明による化合物は、外皮、スクリーン、網、建物、係留およびシグナル伝達系などを、塩水または汽水に接触する物体をコロニー化から保護するために使用することもできる。

【0207】

本発明による化合物はさらに、単独または他の活性化合物の組合せで、防汚剤として用いることができる。

【0208】

本発明による処理方法は、遺伝子組換え体（GMO）、例えば植物または種子を処理するために使用することができる。遺伝子組換え植物（またはトランスジェニック植物）は、異種遺伝子がゲノムに安定して組み込まれている植物である。「異種遺伝子」という表現は、本質的に、植物の外部で提供されるまたは構築される遺伝子を意味し、細胞核に導入されると、葉緑体またはミトコンドリアゲノムが、興味対象のタンパク質もしくはポリペプチドを発現することによって、または植物中に存在する他の遺伝子（単数または複数）を下方制御するまたは発現抑制する（例えば、アンチセンス技術、共抑制技術またはR

10

20

30

40

50

N A干渉（RNAi）技術を使用する。)ことによって、形質転換植物に新たなもしくは改善された農学的特性なまたは他の特性を与える。ゲノム中に位置する異種遺伝子は、導入遺伝子とも呼ばれる。植物ゲノム中の特別位置によって定義される導入遺伝子は、形質転換イベントまたはトランスジェニックイベントと呼ばれる。

【0209】

植物種または栽培品種、これらの位置および成長条件（土壤、気候、生长期間、肥料）に依存して、本発明による処理は、超相加的（「相乗的」）効果をもたらすこともある。したがって、例えば、実際に期待される効果を超える、以下の効果が可能である。本発明に従って使用できる活性化合物および組成物の施用量の減少および／または活性スペクトルの拡大および／または活性における増加、より良好な植物成長、高温または低温に対する耐性の増加、干ばつまたは水もしくは土壤の塩分に対する耐性の増加、開花能力の増加、より簡便な収穫、成熟の加速、より高い収穫率、より大きな果実、より大きな草高、より緑色の葉色、より早い開花、収穫生産物のより高い品質および／またはより高い栄養価、果実内に高い糖濃度、収穫生産物のより良好な貯蔵安定性および／または加工能力。

10

【0210】

特定の施用量で、本発明による活性化合物の組合せは、植物において強化効果も有することがある。すなわち、これらは、望まれない植物病原性真菌および／または微生物および／またはウイルスによる攻撃に対して、植物の防御系を動員するのにも適当である。これは、適切な場合、例えば真菌に対する本発明による組合せの作用を増強する理由の1つであり得る。植物強化（耐性誘発）物質は、本文脈において、望まれない植物病原性真菌および／または微生物および／またはウイルスを引き続いて接種された場合、処理された植物がこれらの望まれない植物病原性真菌および／または微生物および／またはウイルスに対してかなりの程度の抵抗性を示す方法で植物の防御系を刺激する能力がある物質または物質の組合せを意味すると理解されるべきである。本事例において、望まれない植物病原性真菌および／または微生物および／またはウイルスは、植物病原性真菌、細菌およびウイルスを意味すると理解されるべきである。したがって、本発明による物質は、処理後一定の期間内で上述の病原体による攻撃から植物を保護するために用いることができる。保護が有効である期間は、一般に、植物が活性化合物で処理された後1日から10日、好みしくは1日から7日に及ぶ。

20

【0211】

本発明に従って処理されるのが好みしい植物および植物品種として、これらの植物に特に有利で有用な特性を与える遺伝子材料を持つ全ての植物が挙げられる（これが育種によって達成されるとしても、および／またはバイオテクノロジーが無関係であるとしても）。

30

【0212】

本発明に従って処理されるのも好みしい植物および植物品種は、1つ以上の生物ストレス因子に対して抵抗性であり、すなわち前記植物は、線虫、昆虫、ダニ、植物病原性真菌、細菌、ウイルスおよび／またはウイロイドなど動物および微生物の有害生物に対するより良好な防御を有する。

40

【0213】

本発明に従って処理することもできる植物および植物品種は、1つ以上の非生物的ストレス因子に抵抗性である植物である。非生物的ストレス状態として、例えば、干ばつ、冷温曝露、熱曝露、浸透圧ストレス、洪水、土壤塩分の増加、鉱物曝露の増加、オゾン曝露、高い露光量、窒素栄養素の利用制限、リン栄養素の利用制限または遮光回避を挙げることができる。

【0214】

本発明に従って処理することもできる植物および植物品種は、収量特性を増強することを特徴とする植物である。前記植物における収量の増加は、水の使用効率、保水効率、窒素使用の向上、炭素同化作用の増強、光合成の向上、発芽効率の増加および成熟の加速な

50

ど、植物の生理機能、成長および発達の向上の結果であり得る。収量は、早期開花、ハイブリッド種子生産用の開花制御、実生活力、植物の大きさ、節間の数および距離、根の成長、種子の大きさ、果実の大きさ、さやの大きさ、さやまたは穂の数、1つのさやまたは穂当たりの種子数、種子質量、種子充填の増強、種子分散の減少、さやの裂開、ならびに耐倒伏の減少を含めた（ストレスおよび非ストレス状態下における）植物構造の改善によって、さらに影響を受けることがある。さらなる収量形質として、炭水化物含有量、タンパク質含有量、油の含有量および組成、栄養価、抗栄養化合物における減少、加工能力の向上、ならびにより良好な貯蔵安定性などの種子組成が挙げられる。

【0215】

本発明に従って処理することができる植物は、一般に高い収量、活力、健康、ならびに生物的および非生物的ストレス因子に対する抵抗性をもたらす雑種強勢またはハイブリッド効果の特徴を既に発現しているハイブリッド植物である。こうした植物は、通常、自殖性の雄性不稔性親系統（雌親）を別の自殖性の雄性稔性親系統（雄親）と交雑させることによって作製される。ハイブリッド種子は通常、雄性不稔性植物から収穫され、栽培者に販売される。雄性不稔性植物は、時々、（例えば、トウモロコシにおいて）ふさを取り除くこと（すなわち、雄性生殖器または雄花の機械的除去）によって生産されるが、より通常には、雄性不稔性は植物ゲノム中の遺伝的決定因子の結果である。その場合、特に種子がハイブリッド植物から収穫される所望の生成物である場合、通常、雄性不稔性に関与している遺伝的決定因子を含有するハイブリッド植物における雄性稔性が十分回復されるのを確実にすることが有用である。これは、雄性不稔性に関与している遺伝的決定因子を含有するハイブリッド植物における雄性稔性を回復させる能力のある適当な稔性回復遺伝子を雄親が有するのを確実にすることによって達成することができる。雄性不稔性に関する遺伝的決定因子は、細胞質中に位置し得る。細胞質雄性不稔性（CMS）の例は、例えば、 brassica 属各種（Brassica species）に関して示された。しかし、雄性不稔性に関する遺伝的決定因子は、細胞核ゲノム中にも位置することがある。雄性不稔性植物は、遺伝子工学などの植物バイオテクノロジーの方法によって得ることもできる。雄性不稔性植物を得るために有用な手段は、例えばWO 89/10396に記載されており、ここでは、バルナーゼなどのリボヌクレアーゼが雄しべ中のタペータム細胞において選択的に発現される。稔性は次いで、バルスターなどのリボヌクレアーゼ阻害剤のタペータム細胞における発現によって回復され得る。

【0216】

本発明によって処理することができる（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジーの方法によって得られる）植物または植物品種は、除草剤耐性植物、すなわち1つ以上の所定の除草剤に対して耐性にされた植物である。こうした植物は、遺伝子形質転換によって、またはこうした除草剤耐性を付与する突然変異を含有する植物の選択のいずれかによって得ることができる。

【0217】

除草剤耐性植物は、例えばグリフォセート耐性植物、すなわち除草剤グリフォセートまたはこの塩に対して耐性にした植物である。例えば、グリフォセート耐性植物は、酵素5-エノールビルビルシキミ酸-3-リン酸合成酵素（EPSPS）をコードする遺伝子で植物を形質転換することによって得ることができる。こうしたEPSPS遺伝子の例は、細菌サルモネラ・テュピムリウム（Salmonella typhimurium）のaroA遺伝子（変異体CT7）、細菌アグロバクテリウム属種（Agrobacterium sp.）のCP4遺伝子、ペチュニアEPSPS、トマトEPSPS、またはエレウシネ（Eleusine）EPSPSをコードする遺伝子である。これは変異EPSPSであってもよい。グリフォセート耐性植物は、グリフォセートオキシドレダクターゼ酵素をコードする遺伝子を発現させることによって得ることもできる。グリフォセート耐性植物は、グリフォセートアセチルトランスフェラーゼ酵素をコードする遺伝子を発現させることによって得ることもできる。グリフォセート耐性植物は、上述した遺伝子の自然発生突然変異を含有する植物を選択することによって得ることもできる。

10

20

30

40

50

【0218】

他の除草剤抵抗性植物は、例えば、ビアラフォス (bialaphos)、ホスフィノトリシンまたはグルホシネートなど酵素グルタミンシンターゼを阻害する除草剤に対して耐性にした植物である。こうした植物は、除草剤を解毒する酵素、または阻害に抵抗性である変異グルタミンシンターゼ酵素を発現させることによって得ることができる。1つのこうした有効な解毒酵素は、例えば、ホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼ (streptomyces 属各種 (S t r e p t o m y c e s s p e c i e s) 由来の bar または pat タンパク質など) をコードする酵素である。外因性ホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼを発現する植物が記載されている。

【0219】

さらなる除草剤耐性植物は、酵素ヒドロキシフェニルピルベートジオキシゲナーゼ (H P P D) を阻害する除草剤に対して耐性にされた植物もある。ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼは、パラ - ヒドロキシフェニルピルベート (H P P) がホモゲンチセートに形質転換される反応を触媒する酵素である。H P P D 阻害剤に対して耐性の植物は、天然の耐性 H P P D 酵素をコードする遺伝子、または変異 H P P D 酵素をコードする遺伝子で形質転換することができる。H P P D 阻害剤に対する耐性は、H P P D 阻害剤による未変性 H P P D 酵素の阻害にもかかわらずホモゲンチセートの形成を可能にする特定の酵素をコードする遺伝子で植物を形質転換することによって得ることもできる。H P P D 阻害剤に対する植物の耐性は、H P P D 耐性酵素をコードする遺伝子に加えて酵素プレフェナートデヒドロゲナーゼをコードする遺伝子で植物を形質転換することによって向上させることもできる。

10

20

30

【0220】

またさらなる除草剤抵抗性植物は、アセト乳酸シンターゼ (A L S) 阻害剤に対して耐性にした植物である。公知の A L S 阻害剤として、例えばスルホニル尿素、イミダゾリノン、トリアゾロピリミジン、ピリミジニルオキシ (チオ) 安息香酸、および / またはスルホニルアミノカルボニルトリアゾリノン除草剤が挙げられる。A L S 酵素 (アセトヒドロキシ酸シンターゼ、A H A S としても知られている。) における異なる突然変異は、異なる除草剤および除草剤の群に耐性をもたらすことが知られている。スルホニル尿素耐性植物およびイミダゾリノン耐性植物の生産は、国際公開 W O 1 9 9 6 / 0 3 3 2 7 0 に記載されている。さらなるスルホニル尿素およびイミダゾリノン耐性植物は、例えば W O 2 0 0 7 / 0 2 4 7 8 2 に記載されている。

30

【0221】

イミダゾリノンおよび / またはスルホニル尿素に対して耐性の他の植物は、誘発変異原性によって、除草剤の存在下での細胞培養における選択によって、または突然変異育種によって得ることができる。

【0222】

本発明に従って処理することもできる (遺伝子工学などの植物バイオテクノロジーの方法によって得られる) 植物または植物品種は、昆虫抵抗性トランスジェニック植物、すなわち特定の標的昆虫による攻撃に対して抵抗性にした植物である。こうした植物は、遺伝子形質転換によって、またはこうした昆虫抵抗性を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることができる。

40

【0223】

本文脈において、「昆虫抵抗性トランスジェニック植物」という用語は、以下のものをコードするコード配列を含む少なくとも 1 種の導入遺伝子を含有する任意の植物を含める。

1) バキルス・トウリンギエンシス (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s) 由来の殺虫性結晶タンパク質またはこの殺虫性部分 : オンライン http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/ で列挙されている殺虫性結晶タンパク質またはこれらの殺虫性部分、例えば C r y タンパク質部類のタンパク質である C r y 1 A b 、C r y 1 A c 、C r y 1 F 、

50

Cry2Ab、*Cry3Ae*もしくは*Cry3Bb*、またはこれらの殺虫性部分など、または

2) バキルス・トウリンギエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 由来の第二の他の結晶タンパク質またはこの一部分の存在下において殺虫性である、バキルス・トウリンギエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 由来の結晶タンパク質またはこの一部分：*Cy34*および*Cy35*結晶タンパク質から構成されている二成分毒素など、または

3) バキルス・トウリンギエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 由来の2種の異なる殺虫性結晶タンパク質の一部分を含むハイブリッド殺虫性タンパク質：上記1)のタンパク質のハイブリッド、または上記2)のタンパク質のハイブリッド、例えばトウモロコシイベントMON98034 (WO 2007/027777) によって產生される*Cry1A.105*タンパク質など、または

4) 標的昆虫種に対してより高い殺虫活性を得るため、および／または影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するため、および／またはクローニングもしくは形質転換中にコードDNAにおいて誘発された変化のため、一部のアミノ酸、特に1から10のアミノ酸が別のアミノ酸によって置き換えられた、上記1)から3)のいずれか一項のタンパク質：トウモロコシイベントMON863もしくはMON88017における*Cry3Bb1*タンパク質、またはトウモロコシイベントMIR604における*Cry3A*タンパク質など、

5) バキルス・トウリンギエンシス (*Bacillus thuringiensis*) もしくはバキルス・ケレウス (*Bacillus cereus*) 由来の殺虫性分泌タンパク質またはこの殺虫性部分：http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.htmに列挙されている植物性殺虫タンパク質(VIP)、例えばVIP3Aaタンパク質部類由来のタンパク質など、または

6) バキルス・トウリンギエンシス (*Bacillus thuringiensis*) またはB.セロイス (*B. cereus*) 由来の第二分泌タンパク質の存在下において殺虫性である、バキルス・トウリンギエンシス (*Bacillus thuringiensis*) またはバキルス・ケレウス (*Bacillus cereus*) 由来の分泌タンパク質：VIP1aおよびVIP2Aタンパク質から構成される二成分毒素など、

7) バキルス・トウリンギエンシス (*Bacillus thuringiensis*) またはバキルス・ケレウス (*Bacillus cereus*) 由来の異なる分泌タンパク質の一部を含むハイブリッド殺虫性タンパク質：上記1)におけるタンパク質のハイブリッド、または上記2)におけるタンパク質のハイブリッドなど、または

8) 標的昆虫種に対してより高い殺虫活性を得るため、および／または影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するため、および／またはクローニングもしくは形質転換中にコードDNAにおいて誘発された変化のため(一方殺虫性タンパク質をなおコードする。)、一部のアミノ酸、特に1から10のアミノ酸が別のアミノ酸によって置き換えられた、上記1)から3)の一項のタンパク質：綿イベントCOT102におけるVIP3Aaタンパク質など。

【0224】

当然、昆虫抵抗性トランスジェニック植物は、本明細書で使用される場合、上記クラス1から8のいずれか1つのタンパク質をコードする遺伝子の組合せを含む任意の植物も含める。一実施形態において、昆虫抵抗性植物は、同じ標的昆虫種であるが昆虫における異なる受容体結合部位への結合などの異なる作用様式を有する標的昆虫種に対する異なるタンパク質殺虫性を使用することによって、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するため、または植物に対する昆虫抵抗性の発生を遅延するため、上記クラス1から8の1つのタンパク質をコードする1種を超える導入遺伝子を含有する。

【0225】

10

20

30

40

50

本発明に従って処理することもできる（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジーの方法によって得られる）植物または植物品種は、非生物的ストレスに耐性である。こうした植物は、遺伝子形質転換によって、またはこうしたストレス抵抗性を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることができる。特に有用なストレス耐性植物として、以下のものが挙げられる。

a . 植物細胞または植物におけるポリ（A D P - リボース）ポリメラーゼ（P A R P) 遺伝子の発現および／または活性を減少させる能力のある導入遺伝子を含有する植物、

b . 植物または植物細胞の遺伝子をコードするP A R G の発現および／または活性を減少させる能力のあるストレス耐性増強導入遺伝子を含有する植物、

c . ニコチニアミダーゼ、ニコチネートホスホリボシルトランスフェラーゼ、ニコチン酸モノヌクレオチドアデニルトランスフェラーゼ、ニコチニアミドアデニジヌクレオチドシンテターゼまたはニコチニアミドホスホリボシルトランスフェラーゼを含めて、ニコチニアミドアデニジヌクレオチドサルベージ生合成経路の植物機能酵素をコードするストレス耐性増強導入遺伝子を含有する植物。

【0226】

本発明に従って処理することもできる（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジーの方法によって得られる）植物または植物品種は、収穫生産物の量、品質および／もしくは貯蔵安定性の変化、ならびに／または収穫生産物の特異成分の特性の変化、例えば以下のものなどを示す。

1) 改質されたデンプンが特定の用途に、より適するように、物理化学的特性、特にアミロース含有量またはアミロース／アミロペクチン比、枝分かれ度、平均鎖長、側鎖分布、粘度挙動、ゲル強度、デンプン粒の大きさおよび／またはデンプン粒の形態において、野生型植物細胞または植物における合成デンプンと比較して変化している、改質されたデンプンを合成するトランスジェニック植物。

2) 非デンプン炭水化物ポリマーを合成する、または遺伝子組換えをしていない野生型植物と比較して特性の変化した非デンプン炭水化物ポリマーを合成するトランスジェニック植物。例は、特にイヌリン型およびレバン型のポリフルクトースを产生する植物、アルファ - 1 , 4 - グルカンを产生する植物、アルファ - 1 , 6 分枝アルファ - 1 , 4 - グルカンを产生する植物、およびアルテルナンを产生する植物である。

3) ヒアルロンを产生するトランスジェニック植物。

【0227】

本発明に従って処理することもできる（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジーの方法によって得ることができる）植物または植物品種は、纖維特徴の変化した綿植物などの植物である。こうした植物は、遺伝子形質転換によって、またはこうした変化した纖維特徴を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることができ、以下のものが挙げられる。

a) 変化した形態のセルロースシンターゼ遺伝子を含有する、綿植物などの植物、

b) 変化した形態のr s w 2 またはr s w 3 相同核酸を含有する、綿植物などの植物、

c) スクロースリン酸シンターゼの発現の増加した、綿植物などの植物、

d) スクロースシンターゼの発現の増加した、綿植物などの植物、

e) 纖維細胞の基底での原形質連絡開閉の時機が、例えば纖維選択的 - 1 , 3 - グルカナーゼの下方制御を介して変化する、綿植物などの植物、

f) 例えはn o d C およびキチンシンターゼ遺伝子を含めたN - アセチルグルコサミントransフェラーゼ遺伝子の発現を介して反応性の変化した纖維を有する、綿植物などの植物。

【0228】

本発明に従って処理することもできる（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジーの方法によって得られる）植物または植物品種は、油プロファイル特性の変化した、アブラナまたは関連したブ拉斯シカ属（B r a s s i c a ）植物などの植物である。こうした植物

10

20

30

40

50

は、遺伝子形質転換によって、またはこうした変化した油特性を付与する突然変異を含有する植物の選択によって得ることができ、以下のものが挙げられる。

- a) 高いオレイン酸含有量を有する油を产生する、アブラナ植物などの植物、
- b) 低いリノレン酸含有量を有する油を产生する、アブラナ植物などの植物、
- c) 低濃度の飽和脂肪酸を有する油を产生する、アブラナ植物などの植物。

【0229】

本発明に従って処理することができる特に有用なトランスジェニック植物は、1種以上の毒をコードする1種以上の遺伝子を含む植物であり、以下の商品名の下で販売されている以下のものである。YIELD GARD (登録商標) (例えば、トウモロコシ、綿、大豆)、KnockOut (登録商標) (例えば、トウモロコシ)、BiteGuard (登録商標) (例えば、トウモロコシ)、BT-Xtra (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) (綿)、Nucotn (登録商標) (綿)、Nucotn 33B (登録商標) (綿)、NatureGuard (登録商標) (例えば、トウモロコシ)、Protecta (登録商標) およびNewLeaf (登録商標) (ジャガイモ)。挙げができる除草剤耐性植物の例は、以下の商品名の下で販売されているトウモロコシ品種、綿品種および大豆品種である。Roundup Ready (登録商標) (グリフォセートに対して耐性、例えば、トウモロコシ、綿、大豆)、Liberty Link (登録商標) (ホスフィノトリシンに対して耐性、例えば、アブラナ)、IMI (登録商標) (イミダゾリノンに対して耐性) およびSCS (登録商標) (スルホニル尿素に対して耐性、例えば、トウモロコシ)挙げができる除草剤抵抗性植物(除草剤耐性のために従来の方法で育種した植物)は、名称Clearfield (登録商標) (例えば、トウモロコシ)の下で販売されている品種を含める。10

【0230】

本発明に従って処理することができる特に有用なトランスジェニック植物は、例えば、様々な国家または地域の規制当局に関するデータベースに列挙されている形質転換イベントまたは形質転換イベントの組合せを含有する植物である(例えば、http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.asp および <http://www.agbios.com/dbase.php> を参照のこと。)。20

【0231】

本発明によると、列挙されている植物は、特に有利には、本発明による一般式(I)の化合物または該活性化合物の混合物で処理することができる。活性化合物および混合物に関して上記で示されている好ましい範囲は、これらの植物の処理にも当てはまる。特に重視されるのは、本文脈に具体的に示されている化合物および混合物で植物を処理することである。30

【0232】

発明による組成物または活性化合物は、記述されている病原体による攻撃に対して、処理後一定の期間植物を保護するために使用することもできる。保護が提供される期間は、活性化合物での植物の処理後1日から28日、好ましくは1日から14日、特に好ましくは1日から10日、非常に特に好ましくは1日から7日、または種子処理後最大200日に及ぶ。40

【実施例】

【0233】

本発明による式(I)の活性化合物の調製および使用は、下記実施例に示されている。しかし、本発明は、これらの実施例に限定されることはない。

【0234】

概論：特段の記載がない限り、全てのクロマトグラフィーの精製および分離のステップは、0:100の酢酸エチル/シクロヘキサンから100:0の酢酸エチル/シクロヘキサンの溶媒勾配を使用するシリカゲル上で実施される。

【0235】

10

20

30

40

50

式(IVa)の出発原料の調製

2 - (1 - { [3, 5 - ビス(ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 4 - カルバルデヒド(IVa - 1)

塩化オキサリル(3.29 g)および1滴のN,N-ジメチルホルムアミドを、[3, 5 - ビス(ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル]酢酸(2.93 g)のジクロロメタン(30 ml)中溶液に添加する。反応混合物を次いで3時間攪拌する。過剰の塩化オキサリルを次いで減圧下で除去し、残渣をジクロロメタン(10 ml)中にもう一度溶解する。氷浴冷却しながら、溶液を次いで、2 - (ピペリジン - 4 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 4 - カルバルデヒド塩酸塩(3.02 g)のジクロロメタン(20 ml)およびN,N-ジイソプロピルエチルアミン(5.03 g)中懸濁液に添加する。反応混合物を次いで室温に温め、さらに15時間攪拌する。飽和塩化アンモニウム水溶液(5 ml)を次いで反応混合物に添加する。水性相を分離し、ジクロロメタンで抽出する。全ての有機相を合わせ、無水硫酸ナトリウムを使用して乾燥させる。固体を次いで濾別し、溶媒を減圧下で除去する。カラムクロマトグラフィー(シリカゲル、酢酸エチル:ヘキサン 0% - 100% 溶出勾配)による精製により、2 - (1 - { [3, 5 - ビス(ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 4 - カルバルデヒド(1.4 g, 27%)を生成する。

¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): (ppm: 1.57 - 1.63 (m, 1H)、1.80 - 1.86 (m, 1H)、2.09 - 2.15 (m, 2H)、2.82 - 2.88 (m, 1H)、3.24 - 3.31 (m, 1H)、3.38 - 3.45 (m, 1H)、3.95 - 3.99 (m, 1H)、4.33 - 4.36 (m, 1H)、5.35 (d, 1H)、5.43 (d, 1H)、6.90 (s, 1H)、7.02 (t, 1H)、7.17 (t, 1H)、8.64 (s, 1H)、9.90 (s, 1H))
MS(ESI): 405 ([M + H]⁺)

【0236】

式(VIb)の出発原料の調製

1 - [2 - (ピペリジン - 4 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] エタノン塩酸塩(VI - 1)

アルゴンの雰囲気下で、塩酸(ジエチルエーテル中2M、23 ml)を滴下により0で、tert-ブチル4-(4-アセチル-1, 3 - チアゾール - 2 - イル)ピペリジン - 1 - カルボキシレート(920 mg)のジエチルエーテル(2 ml)中溶液に添加する。反応混合物を24時間攪拌する。溶媒および過剰の酸を減圧下で除去する。これにより、1 - [2 - (ピペリジン - 4 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] エタノン塩酸塩(1.05 g)を白色の高吸湿性の固体として生成し、これをさらに直ちに処理する。

¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): (ppm: 2.01 (qd, 2H)、2.28 - 2.20 (m, 2H)、2.55 (s, 3H)、3.02 (q, 2H)、3.38 - 3.27 (m, 2H)、3.42 (m, 1H)、8.39 (s, 1H)、9.06 (bs, 1H)、9.25 (bs, 1H))
MS(ESI): 211 ([M + H - C₁]⁺)

【0237】

式(IVb)の出発原料の調製

1 - [4 - (4 - アセチル - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン(IV - 1)

塩化オキサリル(1.74 g)および1滴のN,N-ジメチルホルムアミドを、[5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル]酢酸(1.00 g)のジクロロメタン(10 ml)中溶液に添加する。反応混合物を次いで24時間攪拌する。過剰の塩化オキサリルを次いで減圧下で除去し、残渣をジクロロメタン(10 ml)中にもう一度溶解する。氷浴冷却しながら、溶液を次いで、1 - [2 - (ピペリジン - 4

10

20

30

40

50

- イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル] エタノン塩酸塩 (1 . 1 3 g) のジクロロメタン (1 0 m l) および N , N - デイソプロピルエチルアミン (1 . 7 7 g) 中懸濁液に添加する。反応混合物を次いで室温に温め、さらに 2 時間攪拌する。飽和塩化アンモニウム水溶液 (5 m l) を次いで反応混合物に添加する。水性相を分離し、ジクロロメタンで抽出する。全ての有機相を合わせ、無水硫酸ナトリウムを使用して乾燥させる。固体を次いで濾別し、溶媒を減圧下で除去する。カラムクロマトグラフィー(シリカゲル、酢酸エチル : ヘキサン 0 % - 1 0 0 % 溶出勾配)による精製により、1 - [4 - (4 - アセチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン (1 . 0 0 g, 5 2 %) (log P (pH 2 . 7) = 2 . 2 5) を生成する。

¹ H NMR (DMSO-d₆, 4 0 0 MHz) : ppm : 1 . 6 5 (bs, 1 H)、1 . 8 0 (bs, 1 H)、2 . 1 8 - 2 . 1 1 (m, 2 H)、2 . 2 3 (s, 3 H)、2 . 5 5 (s, 3 H)、2 . 9 0 (bs, 1 H)、3 . 2 8 (bs, 1 H)、3 . 3 9 (m, 1 H)、4 . 0 0 (bs, 1 H)、4 . 3 3 (bs, 1 H)、5 . 2 2 (bs, 2 H)、6 . 4 5 (s, 1 H)、8 . 3 6 (s, 1 H)
MS (ESI) : 4 0 1 ([M + H]⁺)

【0238】

式(I)の化合物の調製

2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - カルバルデヒド - フェニルオキシム (I - 1)

室温で、O - フェニルヒドロキシルアミン (4 1 m g) および Am b e r l y s t A 2 1 (2 0 0 m g) を、2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - カルバルデヒド (1 0 0 m g) のエタノール中溶液に添加する。反応混合物を室温で 2 4 時間攪拌する。溶媒を次いで減圧下で除去する。カラムクロマトグラフィー(シリカゲル、酢酸エチル : ヘキサン 0 % - 1 0 0 % 溶出勾配)によって残渣を精製する。これにより、シスおよびトランス異性体の約 9 : 1 混合物からなる 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - カルバルデヒド - フェニルオキシム (5 0 m g, 4 0 %) を生成する (log P (pH 2 . 7) = 3 . 7 4 (9 3 %)、3 . 9 4 (7 %))。

¹ H NMR (DMSO-d₆, 4 0 0 MHz) : ppm : 1 . 6 8 (bs, 1 H)、1 . 8 0 (bs, 1 H)、2 . 1 8 - 2 . 1 1 (m, 2 H)、2 . 2 3 (s, 3 H)、2 . 8 9 (bs, 1 H)、3 . 3 0 (bs, 1 H)、3 . 4 0 (m, 1 H)、4 . 0 2 (bs, 1 H)、4 . 3 8 (bs, 1 H)、5 . 2 2 (bs, 2 H)、6 . 4 5 (s, 1 H)、7 . 0 7 (t, 1 H)、7 . 2 4 - 7 . 1 7 (m, 2 H)、7 . 3 8 - 7 . 3 1 (m, 2 H)、8 . 6 6 (s, 1 H)
MS (ESI) : 4 7 8 ([M + H]⁺)

【0239】

2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - (4 - { 4 - [N - (1 - フェニルエトキシ) エタンイミドイル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) エタノン (I - 5)

室温で、(1 - フェニルエトキシ) 塩化アンモニウム (9 1 m g) および Am b e r l y s t A 2 1 (3 0 0 m g) を、1 - [4 - (4 - アセチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン (2 0 0 m g) のエタノール中溶液に添加する。反応混合物を 2 4 時間攪拌し、溶媒を次いで減圧下で除去する。カラムクロマトグラフィー(シリカゲル、酢酸エチル : ヘキサン 0 % - 1 0 0 % 溶出勾配)によって残渣を分離する。これにより、トランスおよびシス異性体の約 9 : 1 混合物からなる 2 - [5 - メチル

10

20

30

40

50

- 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - (4 - {4 - [N - (1 - フェニルエトキシ)エタンイミドイル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル}ピペリジン - 1 - イル)エタノン(230mg、89%)を生成する(10gP(pH2.7)=4.38(89%)、4.54(11%))。

¹H NMR(DMSO-d₆, 400MHz): ppm, : 1.53(d, 3H) 1.62(bs, 1H)、1.77(bs, 1H)、2.15-2.05(m, 2H)、2.22(s, 3H)、2.28(s, 3H)、2.89(bs, 1H)、3.28(bs, 1H)、3.34(m, 1H)、3.98(bs, 1H)、4.33(bs, 1H)、5.21(bs, 2H)、5.31(q, 1H)、6.44(s, 1H)、7.25(m, 1H)、7.48-7.30(m, 4H)、

MS(ESI): 520([M+H]⁺)

【0240】

2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - カルバルデヒドメチル [5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル] ヒドラゾン(I-14)

室温で、2 - (1 - メチルヒドラジニル) - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン(58mg)を、2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - カルバルデヒド(100mg)のエタノール中溶液に添加する。反応混合物を24時間攪拌し、溶媒を次いで減圧下で除去する。カラムクロマトグラフィー(シリカゲル、酢酸エチル:ヘキサン 0% - 100%溶出勾配)によって残渣を精製する。これにより、2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - カルバルデヒドメチル [5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル] ヒドラゾンを生成する(79mg、56%)、(10gP(pH2.7)=4.23)。

¹H NMR(CD₃CN, 400MHz): ppm: 1.90-1.70(3, 2H) 2.24-2.15(m, 2H)、2.25(s, 3H)、2.94(bs, 1H)、3.40-3.25(m, 2H)、3.66(s, 3H)、3.98(bs, 1H)、4.48(bs, 1H)、5.05(bs, 2H)、6.37(s, 1H)、7.69(s, 1H)、7.77(d, 1H)、7.85(dd, 1H)、7.95(s, 1H)、8.50(s, 1H)

MS(ESI): 560([M+H]⁺)

【0241】

2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - (4 - {4 - [N - (ピペリジン - 1 - イル)エタンイミドイル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル} ピペリジン - 1 - イル)エタノン(I-17)

80で、ピペリジン - 1 - アミン(104mg)を、1 - [4 - (4 - アセチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン(46mg)の溶液に添加する。反応混合物をこの温度でさらに2時間攪拌する。塩化アンモニウム水溶液(10ml)を次いで反応混合物に添加する。相分離後、水性相をメチルtert-ブチルエーテル(20ml)で3回抽出する。全ての有機相をNa₂SO₄上で乾燥させる。混合物を次いで濾過し、減圧下で濃縮する。これにより、2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - (4 - {4 - [N - (ピペリジン - 1 - イル)エタンイミドイル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル} ピペリジン - 1 - イル)エタノンを生成する(55mg、99%)、(10gP(pH2.7)=3.69)。

¹H NMR(DMSO-d₆, 400MHz): ppm: 1.50-1.43(m, 2H)、1.85-1.60(m, 6H)、2.15-2.06(m, 2H)、2.22(s, 3H)、2.32(s, 3H)、2.71(m, 4H)、2.90(m, 1H)、3.30(bs, 1H)、3.33(m, 1H)、4.00(bs, 1H)、4.35(

10

20

30

40

50

b s , 1 H) 、 5 . 2 5 - 5 . 1 5 (m , 2 H) 、 6 . 4 5 (s , 1 H) 、 7 . 7 4 (s , 1 H)

MS (E S I) : 4 8 3 ([M + H] ⁺)

【 0 2 4 2 】

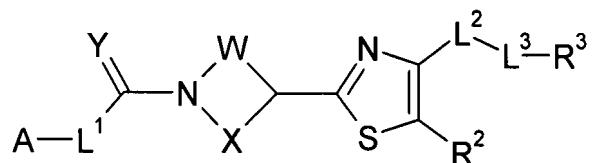
実施例

下記の表 I に列挙されている式 (I) の化合物は、上記に示されている方法と同様にして得ることができる。

【 0 2 4 3 】

【 化 1 8 】

10



【 0 2 4 4 】

【表1】

実施例	A	L ¹	Y	W	X	R ²	L ²	R ⁶	L ³	R ⁷	R ³	log P
I-1	5-メチル-3- -(トリフルオ ロメチル)-1 H-ピラゾール -1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	H	H	結合		フェニル		9.3% (3. 74) /7% (3. 94)
I-2	5-メチル-3- -(トリフルオ ロメチル)-1 H-ピラゾール -1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₂			フェニル		9.3% (3. 63) /7% (3. 80)
I-3	5-メチル-3- -(トリフルオ ロメチル)-1 H-ピラゾール -1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₃			フェニル		9.5% (3. 92) /5% (4. 07)
I-4	5-メチル-3- -(トリフルオ ロメチル)-1 H-ピラゾール -1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₃	結合			フェニル		8.9% (4. 23) /1.1% (4. 46)
I-5	5-メチル-3- -(トリフルオ ロメチル)-1 H-ピラゾール -1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₃	CH ₃			フェニル		8.9% (4. 38) /1.1% (4. 54)

表1

I-6	5-メチル-3-（トリフルオロメチル）-1-H-ピラゾール-1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂ H	H	CH ₂	H	2-メチル-フェニル	93% (3. 96) /7% (4. 12)
I-7	5-メチル-3-（トリフルオロメチル）-1-H-ピラゾール-1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂ H	H	CH ₂	H	4-クロロ-フェニル	91% (4. 04) /9% (4. 23)
I-8	5-メチル-3-（トリフルオロメチル）-1-H-ピラゾール-1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂ H	H	CH ₂ CH ₃	H	4-クロロ-フェニル	55% (4. 34) /45% (4. 50)
I-9	5-メチル-3-（トリフルオロメチル）-1-H-ピラゾール-1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂ H	H	CH ₂	H	2-フルオロフェニル	82% (3. 68) /18% (3. 84)
I-10	5-メチル-3-（トリフルオロメチル）-1-H-ピラゾール-1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂ H	H	CH ₃	CH ₂	フェニル	84% (4. 07) /16% (4. 28)
I-11	5-メチル-3-（トリフルオロメチル）-1-H-ピラゾール-1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂ H	H	CH ₂	H	C ₃ H ₂	ビリジン-2-イル 1. 82

I-1 2	5-メチル-3- -(トリフルオロメチル)-1 H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂	H	CH ₂	フエニル	フェニル	4. 70
I-1 3	5-メチル-3- -(トリフルオロメチル)-1 H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂	H	結合	フエニル	フェニル	4. 77
I-1 4	5-メチル-3- -(トリフルオロメチル)-1 H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂	H	結合	C H ₃	5-(トリフルオロメチル)ビリジン-2-イル	4. 23
I-1 5	5-メチル-3- -(トリフルオロメチル)-1 H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂	H	結合	C H ₃	フェニル	3. 83
I-1 6	5-メチル-3- -(トリフルオロメチル)-1 H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂	H	結合	N R ⁷ R ³ =ペンタシ-1. 5-ジイル	3. 00	
I-1 7	5-メチル-3- -(トリフルオロメチル)-1 H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₃	CH ₃	結合	N R ⁷ R ³ =ペンタシ-1. 5-ジイル	3. 69	

I-18	5-メチル-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₂		2-クロロ-1-フェニル	4. 04
I-19	5-メチル-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ C ₂ H ₂			5. 13
I-20	5-メチル-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ C ₂ H ₂			4. 71
I-21	5-メチル-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ C ₂ H ₂			4. 66
I-22	5-メチル-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ C ₂ H ₂			4. 97
I-23	5-メチル-3-（トリフルオロメチル）-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ C ₂ H ₂			6. 06

10

20

30

40

I-24	3, 5-ビス(トリフルオロ-メチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₂	H	CH ₂	4-クロロ-フェニル	4. 56
I-25	3, 5-ジエチル-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₂	H	CH ₂	4-クロロ-フェニル	3. 70
I-26	5-エチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₂	H	CH ₂	4-クロロ-フェニル	4. 30
I-27	3, 5-ビス(ジフルオロ-メチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₂	H	CH ₂	4-クロロ-フェニル	3. 90
I-28	3-tert-ブチル-5-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₂	H	CH ₂	4-クロロ-フェニル	4. 99
I-29	5-tert-ブチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₂	H	CH ₂	4-クロロ-フェニル	4. 75

10

20

30

40

I-30	3-t e r t- ブチル-5-(ペンタフルオレ チル)-1H- ピラゾール-1 -イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂		4-クロロ -フェニル	5. 3 1
I-31	5-t e r t- ブチル-3-(ペンタフルオロ -エチル)-1 H-ピラゾール -1-イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂		4-クロロ -フェニル	5. 3 1
I-32	3-(ブロノン -2-イル)- 5-(トリフル オロメチル) -1H-ピラゾ -1-イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂		4-クロロ -フェニル	4. 5 6
I-33	5-メチル-3 -(トリフルオ ロメチル)-1 H-ピラゾール -1-イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H			シクロヘキ シル	9.3% (4. 26) /7% (4. 48)
I-34	3, 5-ビス(ジ フルオロメ チル)-1H- ピラゾール-1 -イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H			シクロヘキ シル	9.3% (4. 12) /7% (4. 33)

I-35	2, 5-ジクロロフェニル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	H	結合	シクロヘキ シル	9.2% (5. 10) 8% (5. 45)
I-36	5-メチル-3-((トリフルオロメチル)-1-ヒドロピラゾール-1-イル)	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₂	2, 6-ジ フルオロー フェニル	8.6% (3. 70) 1.4% (3. 86)
I-37	3, 5-ビス(ジフルオロローメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₂	2, 6-ジ フルオロー フェニル	8.3% (3. 58) 1.7% (3. 74)
I-38	2, 5-ジクロロフェニル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₂	2, 6-ジ フルオロー フェニル	9.0% (4. 36) 1.0% (4. 60)
I-39	5-メチル-3-((トリフルオロメチル)-1-ヒドロピラゾール-1-イル)	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₂	2-ブロモ -フェニル	4. 14
I-40	2, 5-ジクロロフェニル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₃	2-ブロモ -フェニル	4. 90
I-41	5-メチル-3-((トリフルオロメチル)-1-ヒドロピラゾール-1-イル)	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₃	CH ₂	2, 6-ジ フルオロー フェニル	7.6% (4. 11) 2.4% (4. 32)
I-42	3, 5-ビス(ジフルオロローメチル)-1H-ピラゾール-1-イル	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₃	CH ₂	2, 6-ジ フルオロー フェニル	9.2% (4. 00) 8% (4. 19)

I-43	2, 5-ジクロロ-4-フェニル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂ H	CH ₃	CH ₂		2, 6-ジフルオロ-4-フェニル	9.2% (4. 91) 8% (5. 16)
I-44	5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1-ヒドロ-2-ピラゾール-1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂ H	CH ₃	CH ₃ 結合		シクロヘキシル	9.0% (4. 02) 10% (4. 12)
I-45	3, 5-ビス(ジフルオロメチル)-1-ヒドロ-2-ピラゾール-1-イル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂ H	CH ₃	CH ₃ 結合		シクロヘキシル	9.1% (4. 69) 9% (4. 88)
I-46	2, 5-ジクロロ-4-フェニル	CH ₂ O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂ H	CH ₃	CH ₃ 結合		シクロヘキシル	9.1% (5. 87) 9% (6. 17)

Io g P値は、下記の方法を使用し、逆相カラム（C18）上のHPLC（高速液体クロマトグラフィー）によって、EEC Directive 79/831 Annex V A8に従つて決定した。

酸性範囲でのLC-MS決定は、移動相O. 1%ギ酸水溶液およびアセトニトリル(O. 1%ギ酸を含有。)、10%アセトニトリルから95%アセト

補間を使用し、保持時間による 10^9 P 値の決定で実施した。

ラムダmax値は、200nmから400nmのUVスペクトルを使用し、クロマトグラフ信号の最大値において決定した。

【表2】
選択された実施例のNMRデータ

実施例	NMRデータ
I-1	¹ H NMR (DMSO-d ₆): δ _{ppm} : 1.68 (bs, 1H) 1.80 (bs, 1H), 2.18-2.11 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.89 (bs, 1H), 3.30 (bs, 1H), 3.40 (m, 1H), 4.02 (bs, 1H), 4.38 (bs, 1H), 5.22 (bs, 2H), 6.45 (s, 1H), 7.07 (t, 1H), 7.24-7.17 (m, 2H), 7.38-7.31 (m, 2H), 8.66 (s, 1H)
I-4	¹ H NMR (DMSO-d ₆): δ _{ppm} : 1.65 (bs, 1H), 1.82 (bs, 1H), 2.16-2.10 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 2.92 (bs, 1H), 3.30 (bs, 1H), 3.39 (m, 1H), 3.99 (m, 1H), 4.35 (bs, 1H), 5.22 (bs, 2H), 6.45 (s, 1H), 7.05 (m, 1H), 7.26-7.23 (m, 2H), 7.38-7.33 (m, 2H), 8.03 (s, 1H)
I-5	¹ H NMR (DMSO-d ₆): δ _{ppm} : 1.53 (d, 3H) 1.62 (bs, 1H), 1.77 (bs, 1H), 2.15-2.05 (m, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.89 (bs, 1H), 3.28 (bs, 1H), 3.34 (m, 1H), 3.98 (bs, 1H), 4.33 (bs, 1H), 5.21 (bs, 2H), 5.31 (q, 1H), 6.44 (s, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.48-7.30 (m, 4H)
I-8	¹ H NMR (CD ₃ CN): δ _{ppm} : 1.54 und 1.61 (d, 3H), 1.88-1.63 (m, 2H), 2.20-2.08 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.88 (bs, 1H), 3.37-3.20 (m, 2H), 3.94 (bs, 1H), 4.44 (bs, 1H), 5.03 (bs, 2H), 5.30 und 5.38 (q, 1H), 6.36 (s, 1H), 7.36 (s, 4H), 7.53 und 7.60 (s, 1H), 8.21 und 8.36 (s, 1H)
I-10	¹ H NMR (CD ₃ CN): δ _{ppm} : 1.88-1.63 (m, 2H), 2.18-2.20 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.88 (bs, 1H), 2.97 (s, 3H), 3.32-3.24 (m, 2H), 3.94 (bs, 1H), 4.43 (bs, 1H), 4.59 (s, 2H), 5.04 (bs, 2H), 6.36 (s, 1H), 7.19 und 7.20 (dd, 1H), 7.25 (s, 1H), 7.28 (d, 1H), 7.34 (s, 1H), 7.68 und 7.70 (dd, 1H), 8.51 und 8.52 (s, 1H)
I-11	¹ H NMR (DMSO-d ₆): δ _{ppm} : 1.62 (bs, 1H), 1.78 (bs, 1H), 2.14-2.05 (m, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.89 (bs, 1H), 3.28 (bs, 1H), 3.34 (m, 1H), 3.98 (bs, 1H), 4.33 (bs, 1H), 5.18 (s, 2H), 5.20 (bs, 2H), 6.44 (s, 1H), 7.40-7.28 (m, 5H), 7.74 (s, 1H)
I-12	¹ H NMR (CD ₃ CN): δ _{ppm} : 1.86-1.58 (m, 2H), 2.15-2.04 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.88 (bs, 1H), 3.30-3.21 (m, 2H), 3.92 (bs, 1H), 4.43 (bs, 1H), 5.03 (bs, 2H), 5.22 (s, 2H), 6.36 (s, 1H), 6.95 (dd, 1H), 7.43-7.21 (m, 9H), 7.50 (s, 1H), 7.55 (s, 1H)
I-13	¹ H NMR (CD ₃ CN): δ _{ppm} : 1.68 (m, 1H), 1.85 (m, 1H), 2.18-2.08 (m, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.83 (m, 1H), 3.32-3.23 (m, 2H), 3.91 (m, 1H), 4.43 (m, 1H), 5.02 (d, 1H), 5.09 (d, 1H), 6.39 (s, 1H), 7.28-7.18 (m, 6H), 7.49-7.43 (m, 5H), 7.55 (s, 1H)
I-14	¹ H NMR (CD ₃ CN): δ _{ppm} : 1.90-1.70 (3, 2H) 2.24-2.15 (m, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.94 (bs, 1H), 3.40-3.25 (m, 2H), 3.66 (s, 3H), 3.98 (bs, 1H), 4.48 (bs, 1H), 5.05 (bs, 2H), 6.37 (s, 1H), 7.69 (s, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.85 (dd, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.50 (s, 1H)
I-15	¹ H NMR (CD ₃ CN): δ _{ppm} : 1.95-1.65 (m, 2H), 2.22-2.12 (m, 2H), 2.24 (s, 3H), 2.90 (bs, 1H), 3.38-3.23 (m, 2H), 3.52 (s, 3H), 3.97 (bs, 1H), 4.48 (bs, 1H), 5.07 (bs, 2H), 6.37 (s, 1H), 6.93 (dd, 1H), 7.35-7.27 (m, 2H), 7.40-7.36 (m, 2H), 7.51 (s, 1H), 7.68 (s, 1H)
I-16	¹ H NMR (CD ₃ CN): δ _{ppm} : 1.17 (dd, 1H), 1.52 (m, 1H), 1.72-1.60 (m, 5H), 1.83 (m, 1H), 2.20-2.05 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.83 (m, 1H), 3.10 (dd, 3H), 3.33-3.24 (m, 2H), 3.58 (m, 1H), 3.94 (m, 1H), 4.48 (m, 1H), 5.03 (d, 1H), 5.10 (d, 1H), 6.39 (s, 1H), 7.32 (s, 1H), 7.60 (s, 1H)
I-17	¹ H NMR (DMSO-d ₆): δ _{ppm} : 1.50-1.43 (m, 2H), 1.85-1.60 (m, 6H), 2.15-2.06 (m, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 2.71 (m, 4H), 2.90 (m, 1H), 3.30 (bs, 1H), 3.33 (m, 1H), 4.00 (bs, 1H), 4.35 (bs, 1H), 5.25-5.15 (m, 2H), 6.45 (s, 1H), 7.74 (s, 1H)
I-18	¹ H NMR (DMSO-d ₆): δ _{ppm} : 1.61 (bs, 1H), 1.78 (bs, 1H), 2.14-2.05 (m, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.86 (bs, 1H), 3.28 (bs, 1H), 3.35 (m, 1H), 3.97 (bs, 1H), 4.34 (bs, 1H), 5.21 (bs, 2H), 5.36 (s, 2H), 6.44 (s, 1H), 7.40-7.33 (m, 2H), 7.54-7.44 (m, 2H), 7.85 (s, 1H), 8.34 (s, 1H)
I-19	¹ H NMR (DMSO-d ₆): δ _{ppm} : 0.88 (t, 3H), 1.42-1.25 (m, 6H), 1.65 (td, 2H), 1.90-1.55 (m, 2H), 2.15-2.07 (m, 2H), 2.21 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.89 (bs, 1H), 3.30 (bs, 1H), 3.34 (m, 1H), 3.98 (bs, 1H), 4.11 (t, 2H), 4.33 (bs, 1H), 5.21 (bs, 2H), 6.44 (s, 1H), 7.72 (s, 1H)

10

20

30

40

実施例	NMRデータ
I-20	¹ H NMR (DMSO-d ₆): δ _{ppm} : 0.89 und 1.05 (t, 3H), 1.38-1.30 und 1.52-1.46 (m, 4H), 1.67 und 1.79 (m, 2H), 1.86-1.60 (m, 2H), 2.15-2.06 (m, 2H), 2.21 und 2.35 (s, 3H), 2.22 und 2.36 (s, 3H), 2.89 (bs, 1H), 3.30 (bs, 1H), 3.34 und 3.49 (m, 1H), 3.98 (bs, 1H), 4.11 und 4.25 (t, 2H), 4.33 und 4.48 (bs, 1H), 5.21 und 5.37 (bs, 2H), 6.45 und 6.59 (s, 1H), 7.72 und 7.86 (s, 1H)
I-21	¹ H NMR (DMSO-d ₆): δ _{ppm} : 1.63 (bs, 1H), 1.78 (bs, 1H), 1.97 (td, 2H), 2.15-2.04 (m, 2H), 2.20 (s, 6H), 2.69 (t, 2H), 2.88 (bs, 1H), 3.28 (bs, 1H), 3.34 (m, 1H), 3.99 (bs, 1H), 4.13 (t, 2H), 4.34 (bs, 1H), 5.21 (bs, 2H), 6.44 (s, 1H), 7.30-7.11 (5H), 7.73 (s, 1H)
I-22	¹ H NMR (DMSO-d ₆): δ _{ppm} : 1.88-1.50 (m, 6H), 2.15-2.07 (2H), 2.21 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.67-2.60 (m, 2H), 2.89 (bs, 1H), 3.30 (bs, 1H), 3.34 (m, 1H), 3.98 (bs, 1H), 4.14 (t, 2H), 4.33 (bs, 1H), 5.21 (bs, 2H), 6.45 (s, 1H), 7.30-7.11 (m, 5H), 7.71 (s, 1H)
I-23	¹ H NMR (DMSO-d ₆): δ _{ppm} : 0.87 (t, 3H), 1.42-1.21 (m, 11H), 1.85-1.45 (m, 4H), 2.15-2.06 (m, 2H), 2.20 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.88 (bs, 1H), 3.29 (bs, 1H), 3.34 (m, 1H), 3.99 (bs, 1H), 4.23 (m, 1H), 4.32 (bs, 1H), 5.21 (bs, 2H), 6.45 (s, 1H), 7.70 (s, 1H)

ppmでの化学NMRシフトは、溶媒 DMSO-d₆ 中において、内部標準としてテトラメチルシリランを使用し、表示されていない限り400MHzで測定した。

以下の略語は、下記の信号分割を示す。

b=ブロード、s=一重項、d=二重項、t=三重項、q=四重項、m=多重項

【0246】

使用実施例

実施例 A

ピュトプトラ (Phytophthora) 試験 (トマト) / 保護性

溶媒 : N,N-ジメチルホルムアミド 49 重量部

乳化剤 : アルキルアリールポリグリコールエーテル 1 重量部

活性化合物の適当な調製物を生成するため、活性化合物 1 重量部を、記載量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を所望濃度まで水で希釈する。

【0247】

保護活性に関して試験するため、若いトマトに、活性化合物の調製物を記載施用量にて噴霧する。処理後 1 日、植物にピュトプトラ・インフェスタンス (Phytophthora infestans) の胞子懸濁液を接種し、次いで、100% 相対湿度および 22 度 24 時間そのままにする。該植物を次いで、約 96% の相対大気湿度および 20 の温室で、気候調節チャンバ内に置く。

【0248】

評価を接種の 7 日後に実施する。0% は対照の効力に相当する効力を意味し、一方 100% の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【0249】

この試験において、表 I からの本発明による化合物番号 I - 1、I - 2、I - 3、I - 4、I - 5、I - 6、I - 7、I - 9、I - 12、I - 13、I - 14、I - 15、I - 16、I - 18、I - 19、I - 20、I - 21、I - 22、I - 23、I - 24、I - 25、I - 26、I - 27 および I - 32 は、500 ppm の活性化合物濃度で 70% 以上の効力を示す。

【0250】

実施例 B

プラスモパラ (Plasmopara) 試験 (ブドウ) / 保護性

溶媒 : アセトン 24.5 重量部

ジメチルアセトアミド 24.5 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 1 重量部

活性化合物の適当な調製物を生成するため、活性化合物 1 重量部を、記載量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を所望濃度まで水で希釈する。

10

20

30

40

50

【 0 2 5 1 】

保護活性に関して試験するため、若い植物に、活性化合物の調製物を記載施用量にて噴霧する。スプレーコーティングを乾燥させた後、植物にプラスモバラ・ヴィティコラ (Plasmopara viticola) の水性胞子懸濁液を接種し、次いでインキュベーションキャビン内に約 20 および 100 % 相対大気湿度で 1 日間そのままにする。植物を次いで、温室に約 21 および約 90 % の大気湿度で 4 日間置く。植物を次いで湿らせ、インキュベーションキャビン内に 1 日間置く。

【 0 2 5 2 】

評価を接種の 6 日後に実施する。0 % は対照の効力に相当する効力を意味し、一方 100 % の効力は、感染が観察されないことを意味する。

10

【 0 2 5 3 】

この試験において、表 I からの本発明による化合物番号 I - 1、I - 2、I - 3、I - 4、I - 5、I - 6、I - 7、I - 9、I - 18、I - 19、I - 22、I - 24、I - 25、I - 26、I - 27 および I - 32 は、100 ppm の活性化合物濃度で、70 % 以上の効力を示す。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

		International application No PCT/EP2009/008492						
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D417/14 A01N43/78 A01P3/00								
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC								
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D A01N A01P								
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched								
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) EPO-Internal, CHEM ABS Data, BEILSTEIN Data								
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT <table border="1" style="width: 100%; border-collapse: collapse;"> <thead> <tr> <th style="text-align: left; padding: 2px;">Category*</th> <th style="text-align: left; padding: 2px;">Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages</th> <th style="text-align: left; padding: 2px;">Relevant to claim No.</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td style="padding: 2px;">A</td> <td style="padding: 2px;">WO 2008/013622 A2 (DU PONT [US]; PASTERIS ROBERT JAMES [US]; HANAGAN MARY ANN [US]; SHAPI) 31 January 2008 (2008-01-31) cited in the application page 78; example 2c page 97; table 1a claims</td> <td style="padding: 2px;">1-9</td> </tr> </tbody> </table>			Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.	A	WO 2008/013622 A2 (DU PONT [US]; PASTERIS ROBERT JAMES [US]; HANAGAN MARY ANN [US]; SHAPI) 31 January 2008 (2008-01-31) cited in the application page 78; example 2c page 97; table 1a claims	1-9
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.						
A	WO 2008/013622 A2 (DU PONT [US]; PASTERIS ROBERT JAMES [US]; HANAGAN MARY ANN [US]; SHAPI) 31 January 2008 (2008-01-31) cited in the application page 78; example 2c page 97; table 1a claims	1-9						
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.								
* Special categories of cited documents : "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the International filing date but later than the priority date claimed								
Date of the actual completion of the International search	Date of mailing of the International search report							
15 February 2010	22/02/2010							
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5018 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Authorized officer Kollmannsberger, M							

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2009/008492

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)		Publication date
WO 2008013622	A2 31-01-2008	AR	063213 A1	14-01-2009
		AU	2007277157 A1	31-01-2008
		CA	2653640 A1	31-01-2008
		CL	21852007 A1	13-06-2008
		EP	2049111 A2	22-04-2009
		KR	20090033496 A	03-04-2009
		US	2009156592 A1	18-06-2009
		UY	30510 A1	29-02-2008

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP2009/008492

A. KLASSEIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES INV. C07D417/14 A01N43/78 A01P3/00
--

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassefikation und der IPC

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchiertes Mindestpräzess (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) C07D A01N A01P
--

Recherchierte, aber nicht zum Mindestpräzess gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der Internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, BEILSTEIN Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN
--

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 2008/013622 A2 (DU PONT [US]; PASTERIS ROBERT JAMES [US]; HANAGAN MARY ANN [US]; SHAPI) 31. Januar 2008 (2008-01-31) in der Anmeldung erwähnt Seite 78; Beispiel 2c Seite 97; Tabelle 1a Ansprüche -----	1-9

<input type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen	X Siehe Anhang Patentreihe
--	----------------------------

- * Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
 "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
 "E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
 "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
 "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung oder andere Maßnahmen bezieht
 "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist
- "T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
 "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfindenderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
 "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfindenderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
 "&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentreihe ist

Datum des Abschlusses der Internationalen Recherche	Abseriedatum des Internationalen Recherchenberichts
---	---

15. Februar 2010	22/02/2010
------------------	------------

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patenlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Bevollmächtigter Bediensteter Kollmannsberger, M
---	---

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur seien Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2009/008492

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2008013622	A2 31-01-2008	AR 063213 A1 14-01-2009	
		AU 2007277157 A1 31-01-2008	
		CA 2653640 A1 31-01-2008	
		CL 21852007 A1 13-06-2008	
		EP 2049111 A2 22-04-2009	
		KR 20090033496 A 03-04-2009	
		US 2009156592 A1 18-06-2009	
		UY 30510 A1 29-02-2008	

フロントページの続き

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

(72)発明者 土屋 知己

ドイツ国、4 0 2 2 7 ・ デュッセルドルフ、ゾンネンシュトラーセ・ 6 4

(72)発明者 バツヘンドルフ・ノイマン , ウルリケ

ドイツ国、5 6 5 6 6 ・ ノイビート、オーベラー・マルケンベーク・ 8 5

(72)発明者 フエールステ , アルント

ドイツ国、5 0 6 7 4 ・ ケルン、モーツアルトシュトラーセ・ 3 - 5

(72)発明者 ベンテイング , ユルゲン

ドイツ国、4 2 7 9 9 ・ ライヒリンゲン、アムセルシュトラーセ・ 7

F ターム(参考) 4C063 AA01 AA03 AA05 BB01 CC62 DD10 EE03

4H011 AA01 BA01 BB10 DA16 DC05