

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第4745979号
(P4745979)

(45) 発行日 平成23年8月10日(2011.8.10)

(24) 登録日 平成23年5月20日(2011.5.20)

(51) Int.Cl.

C07F	7/12	(2006.01)	F 1
C07F	7/08	(2006.01)	C07F 7/08
A01N	55/00	(2006.01)	C07F 7/08
A01P	3/00	(2006.01)	C07F 7/12
C07B	61/00	(2006.01)	AO1N 55/00

C07F	7/12	C S P V
C07F	7/08	R
C07F	7/08	S
C07F	7/12	R
AO1N	55/00	D

請求項の数 8 (全 43 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2006-540234 (P2006-540234)
 (86) (22) 出願日 平成16年11月6日 (2004.11.6)
 (65) 公表番号 特表2007-511555 (P2007-511555A)
 (43) 公表日 平成19年5月10日 (2007.5.10)
 (86) 國際出願番号 PCT/EP2004/012590
 (87) 國際公開番号 WO2005/049624
 (87) 國際公開日 平成17年6月2日 (2005.6.2)
 審査請求日 平成19年11月5日 (2007.11.5)
 (31) 優先権主張番号 10354607.3
 (32) 優先日 平成15年11月21日 (2003.11.21)
 (33) 優先権主張国 ドイツ (DE)

(73) 特許権者 302063961
 バイエル・クロツプサイエンス・アクチエ
 ンゲゼルシヤフト
 ドイツ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 100062007
 弁理士 川口 義雄
 (74) 代理人 100114188
 弁理士 小野 誠
 (74) 代理人 100140523
 弁理士 渡邊 千尋
 (74) 代理人 100119253
 弁理士 金山 賢教
 (74) 代理人 100103920
 弁理士 大崎 勝真

最終頁に続く

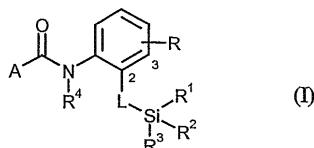
(54) 【発明の名称】シリル化カルボキサミド

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(I)のシリル化カルボキサミド。

【化 1】



(式中、

Rは、水素、フッ素、塩素、メチル、イソプロピル、メチルチオ又はトリフルオロメチルを表し、

Lは直接結合を表し、又は各場合において場合によってはハロゲンで置換されていてよい直鎖若しくは分枝アルキレン(アルカンジイル)、アルケニレン(アルケンジイル)若しくはアルキニレン(アルキンジイル)を表し、

R¹及びR²は互いに独立に水素、C₁-C₈-アルキル、C₁-C₈-アルコキシ、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキル又はC₁-C₆-ハロアルキルを表し、R³は、水素、C₁-C₈-アルキル、C₁-C₈-アルコキシ、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキル、C₂

10

20

- C₈ - アルケニル、C₂ - C₈ - アルキニル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキルを表し、又はフェニル若しくはフェニルアルキルを表し、

R⁴ は、水素、C₁ - C₈ - アルキル、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁ - C₆ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルフィニル、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルホニル、C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル；ホルミル、ホルミル - C₁ - C₃ - アルキル、(C₁ - C₃ - アルキル)カルボニル - C₁ - C₃ - アルキル、(C₁ - C₃ - アルコキシ)カルボニル - C₁ - C₃ - アルキル；各場合において1から13個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有する、ハロ - (C₁ - C₃ - アルキル)カルボニル - C₁ - C₃ - アルキル、ハロ - (C₁ - C₃ - アルコキシ)カルボニル - C₁ - C₃ - アルキル、

(C₁ - C₈ - アルキル)カルボニル、(C₁ - C₈ - アルコキシ)カルボニル、(C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル)カルボニル、(C₃ - C₈ - シクロアルキル)カルボニル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有する、(C₁ - C₆ - ハロアルキル)カルボニル、(C₁ - C₆ - ハロアルコキシ)カルボニル、(ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル)カルボニル、(C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル)カルボニル；又は - C(=O)C(=O)R⁵、- CONR⁶

R⁷ 若しくは - CH₂NR⁸R⁹ を表し、

R⁵ は、水素、C₁ - C₈ - アルキル、C₁ - C₈ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁ - C₆ - ハロアルキル、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ、ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキルを表し、

R⁶ 及び R⁷ は互いに独立に各々、水素、C₁ - C₈ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有する、C₁ - C₈ - ハロアルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキルを表し、

また、R⁶ と R⁷ はそれらが結合している窒素原子と一緒に、ハロゲン及び C₁ - C₄ アルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基で場合によっては一置換又は多置換されていてもよい、5から8個の環原子を有する飽和複素環を形成し、該複素環は、酸素、硫黄及び NR¹⁰ からなる群から選択される1又は2個のさらなる非隣接ヘテロ原子を含むことができ、

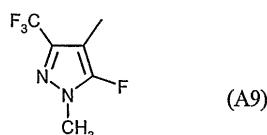
R⁸ 及び R⁹ は互いに独立に、水素、C₁ - C₈ - アルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有する、C₁ - C₈ - ハロアルキル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキルであり、

また、R⁸ と R⁹ はそれらが結合している窒素原子と一緒に、ハロゲン及び C₁ - C₄ アルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基で場合によっては一置換又は多置換されていてもよい、5から8個の環原子を有する飽和複素環を形成し、該複素環は、酸素、硫黄及び NR¹⁰ からなる群から選択される1又は2個のさらなる非隣接ヘテロ原子を含むことができ、

R¹⁰ は水素又は C₁ - C₆ - アルキルを表し、

A は式 (A9) :

【化2】



の基を表す。)

【請求項 2】

R が、水素、フッ素、塩素、メチル又はトリフルオロメチルを表し、

L が、直接結合を表し、又は各場合において場合によってはハロゲン置換されていてもよい直鎖若しくは分枝、C₁ - C₆ - アルキレン、C₂ - C₆ - アルケニレン若しくはC₂ - C₆ - アルキニレンを表し、

R¹ 及び R² が互いに独立に、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₃ - アルコキシ - C₁ - C₃ - アルキル又はC₁ - C₃ - アルキルチオ - C₁ - C₃ - アルキルを表し、

R³ が、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₃ - アルコキシ - C₁ - C₃ - アルキル、C₁ - C₃ - アルキルチオ - C₁ - C₃ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、フェニル又はベンジルを表し、

R⁴ が、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₄ - アルキルスルホニル、C₁ - C₃ - アルコキシ - C₁ - C₃ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル；各場合において 1 から 9 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有する、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルフィニル、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルホニル、ハロ - C₁ - C₃ - アルコキシ - C₁ - C₃ - アルキル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル；ホルミル、ホルミル - C₁ - C₃ - アルキル、(C₁ - C₃ - アルキル) カルボニル - C₁ - C₃ - アルキル、(C₁ - C₃ - アルコキシ) カルボニル - C₁ - C₃ - アルキル；各場合において 1 から 1 3 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有する、ハロ - (C₁ - C₃ - アルキル) カルボニル - C₁ - C₃ - アルキル、ハロ - (C₁ - C₃ - アルコキシ) カルボニル - C₁ - C₃ - アルキル、

(C₁ - C₆ - アルキル) カルボニル、(C₁ - C₄ - アルコキシ) カルボニル、(C₁ - C₃ - アルコキシ - C₁ - C₃ - アルキル) カルボニル、(C₃ - C₆ - シクロアルキル) カルボニル；各場合において 1 から 9 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有する、(C₁ - C₄ - ハロアルキル) カルボニル、(C₁ - C₄ - ハロアルコキシ) カルボニル、(C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル) カルボニル；又は - C(=O)C(=O)R⁵、- CONR⁶

R⁷ 若しくは - CH₂NR⁸R⁹ を表し、

R⁵ が、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₃ - アルコキシ - C₁ - C₃ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル；各場合において 1 から 9 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有する、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、ハロ - C₁ - C₃ - アルコキシ - C₁ - C₃ - アルキル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキルを表し、

R⁶ 及び R⁷ が互いに独立に各々、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₃ - アルコキシ - C₁ - C₃ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル；各場合において 1 から 9 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有する、C₁ - C₄ - ハロアルキル、ハロ - C₁ - C₃ - アルコキシ - C₁ - C₃ - アルキル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキルを表し、

また、R⁶ と R⁷ がそれらが結合している窒素原子と一緒に、ハロゲン及び C₁ - C₄ - アルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基で場合によっては一置換から四置換されていてもよい、5 又は 6 個の環原子を有する飽和複素環を形成し、該複素環は、酸素、硫黄及び NR¹⁰ からなる群から選択される 1 又は 2 個のさらなる非隣接ヘテロ原子を含むことができ、

R⁸ 及び R⁹ が互いに独立に、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル；各場合において 1 から 9 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有する、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキルを表し、

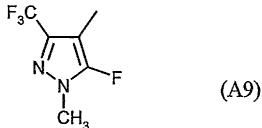
また、R⁸ と R⁹ がそれらが結合している窒素原子と一緒に、ハロゲン及び C₁ - C₄ - アルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基で場合によっては一置換又は多置換されていてもよい、5 から 6 個の環原子を有する飽和複素環を形成し、該複素環は

、酸素、硫黄及びN R¹⁻⁰からなる群から選択される1又は2個のさらなる非隣接ヘテロ原子を含むことができ、

R¹⁻⁰が水素又はC₁-C₄-アルキルを表し、

Aが式(A9)の基を表す

【化3】



ことを特徴とする、請求項1に記載の式(I)のシリル化カルボキサミド。

10

【請求項3】

式(II)：

【化4】



(式中、

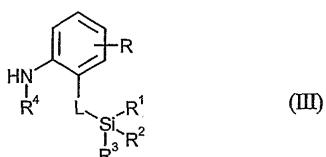
X¹はハロゲン又はヒドロキシルを表し、

Aは、請求項1に定義されたとおりを表す。)のカルボン酸誘導体を、

妥当な場合には触媒の存在下で、妥当な場合には縮合剤の存在下で、妥当な場合には酸結合剤の存在下で、かつ妥当な場合には希釈剤の存在下で、式(II)：

20

【化5】



(式中、R、L、R¹、R²、R³及びR⁴は請求項1に定義されたとおりを表す。)のアミンと反応させること

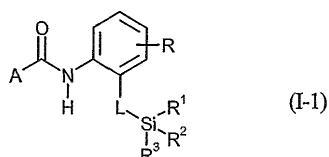
を特徴とする、請求項1に記載の式(I)のシリル化カルボキサミドを調製する方法。

30

【請求項4】

式(I-1)：

【化6】



(式中、R、L、R¹、R²、R³及びAは請求項1に定義されたとおりを表す。)のシリル化カルボキサミドを、

40

塩基の存在下及び希釈剤の存在下で、式(VIII)：

【化7】



(式中、

X²は塩素、臭素又はヨウ素を表し、

R^{4a}は、C₁-C₈-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₃-C₈-シクロアルキル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有する、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₄-ハロアルキルチオ、C₁-C₄-ハロアルキル

50

スルフィニル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルホニル、ハロ- $C_1 - C_4$ - アルコキシ- $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルキル；ホルミル、ホルミル- $C_1 - C_3$ - アルキル、($C_1 - C_3$ - アルキル)カルボニル- $C_1 - C_3$ - アルキル、($C_1 - C_3$ - アルコキシ)カルボニル- $C_1 - C_3$ - アルキル；各場合において1から13個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するハロ-($C_1 - C_3$ - アルキル)カルボニル- $C_1 - C_3$ - アルキル、ハロ-($C_1 - C_3$ - アルコキシ)カルボニル- $C_1 - C_3$ - アルキル；

($C_1 - C_8$ - アルキル)カルボニル、($C_1 - C_8$ - アルコキシ)カルボニル、($C_1 - C_4$ - アルコキシ- $C_1 - C_4$ - アルキル)カルボニル、($C_3 - C_8$ - シクロアルキル)カルボニル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有する、($C_1 - C_6$ - ハロアルキル)カルボニル、($C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ)カルボニル、(ハロ- $C_1 - C_4$ - アルコキシ- $C_1 - C_4$ - アルキル)カルボニル、($C_3 - C_8$ - ハロシクロアルキル)カルボニル；又は- $C(=O)C(=O)R^5$ 、- $C(=O)R^6$ 、- $C(=O)NR^7$ 若しくは- $CH_2NR^8R^9$ を表し、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 及び R^9 は請求項1に定義されたとおりを表す。)のハロゲン化物と反応させること

を特徴とする、請求項1に記載の式(I)のシリル化カルボキサミドを調製する方法。

【請求項5】

增量剤及び/又は界面活性剤に加えて、請求項1に記載の少なくとも1個の式(I)のシリル化カルボキサミドを含むことを特徴とする、望ましくない微生物を抑制するための組成物。

【請求項6】

望ましくない微生物を抑制するための、請求項1に記載の式(I)のシリル化カルボキサミドの使用。

【請求項7】

請求項1に記載の式(I)のシリル化カルボキサミドを微生物及び/又はその生息地に適用することを特徴とする、望ましくない微生物を抑制するための方法。

【請求項8】

請求項1に記載の式(I)のシリル化カルボキサミドを增量剤及び/又は界面活性剤と混合することを特徴とする、望ましくない微生物を抑制するための組成物を調製する方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規シリル化カルボキサミド、その調製用プロセス及び望ましくない微生物を抑制するためのその使用プロセスに関する。

【背景技術】

【0002】

多数のカルボキサミドが殺真菌性を有することはすでに知られている(例えば、国際公開第03/080628号、同03/010149号、EP-A 0 589 301、EP-A 0 545 099を参照されたい)。これらの化合物の活性は良好であるが、例えば低散布量では不十分な場合がある。

【発明の開示】

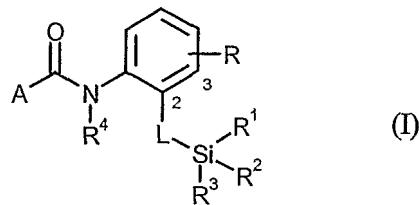
【課題を解決するための手段】

【0003】

本発明は、式(I)の新規シリル化カルボキサミドを提供する。

【0004】

【化28】



式中、

Rは、水素、フッ素、塩素、メチル、イソプロピル、メチルチオ又はトリフルオロメチルを表し、10

Lは直接結合を表し、又は各場合において場合によっては置換されていてもよい直鎖若しくは分枝アルキレン(アルカンジイル)、アルケニレン(アルケンジイル)又はアルキニレン(アルキンジイル)を表し、

R¹及びR²は互いに独立に水素、C₁ - C₈ - アルキル、C₁ - C₈ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキルチオ - C₁ - C₄ - アルキル又はC₁ - C₆ - ハロアルキルを表し、

R³は、水素、C₁ - C₈ - アルキル、C₁ - C₈ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキルチオ - C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₈ - アルケニル、C₂ - C₈ - アルキニル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキルを表し、20又は各場合において場合によっては置換されていてもよいフェニル若しくはフェニルアルキルを表し、

R⁴は、水素、C₁ - C₈ - アルキル、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁ - C₆ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルフィニル、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルホニル、ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル；ホルミル、ホルミル - C₁ - C₃ - アルキル、(C₁ - C₃ - アルキル)カルボニル - C₁ - C₃ - アルキル、(C₁ - C₃ - アルコキシ)カルボニル - C₁ - C₃ - アルキル；各場合において1から13個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するハロ - (C₁ - C₃ - アルキル)カルボニル - C₁ - C₃ - アルキル、ハロ - (C₁ - C₃ - アルコキシ)カルボニル - C₁ - C₃ - アルキル、30

(C₁ - C₈ - アルキル)カルボニル、(C₁ - C₈ - アルコキシ)カルボニル、(C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル)カルボニル、(C₃ - C₈ - シクロアルキル)カルボニル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有する(C₁ - C₆ - ハロアルキル)カルボニル、(C₁ - C₆ - ハロアルコキシ)カルボニル、(ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル)カルボニル、(C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル)カルボニル；又は - C(=O)C(=O)R⁵、-CONR⁶40

R⁷若しくは - CH₂NR⁸R⁹を表し、

R⁵は、水素、C₁ - C₈ - アルキル、C₁ - C₈ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁ - C₆ - ハロアルキル、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ、ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキルを表し、50

R⁶及びR⁷は互いに独立に各々、水素、C₁ - C₈ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁ - C₈ - ハロアルキル、ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキルを表し、

また、R⁶とR⁷はそれらが結合している窒素原子と一緒に、ハロゲン及びC₁ - C₄ - アルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基で場合によっては一置換又は多置換されていてもよい、5から8個の環原子を有する飽和複素環を形成し、該複素環は、酸素、硫黄及びNR¹⁰からなる群から選択される1又は2個のさらなる非隣接ヘテロ原子を含むことができ、

R⁸及びR⁹は互いに独立に、水素、C₁ - C₈ - アルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁ - C₈ - ハロアルキル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキルを表し、

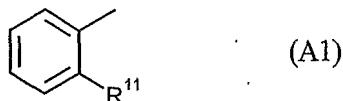
また、R⁸とR⁹はそれらが結合している窒素原子と一緒に、ハロゲン及びC₁ - C₄ - アルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基で場合によっては一置換又は多置換されていてもよい、5から8個の環原子を有する飽和複素環を形成し、該複素環は、酸素、硫黄及びNR¹⁰からなる群から選択される1又は2個のさらなる非隣接ヘテロ原子を含むことができ、

R¹⁰は水素又はC₁ - C₆ - アルキルを表し、

Aは式(A1)の基を表し、

【0005】

【化29】



(式中、R¹¹は、水素、ハロゲン、ヒドロキシリル、シアノ、C₁ - C₆ - アルキル、各場合において1から5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ又はC₁ - C₄ - ハロアルキルチオを表す。)

又は

Aは式(A2)の基を表し、

【0006】

【化30】



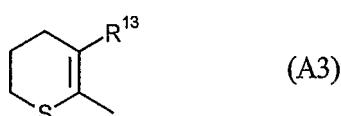
(式中、R¹²は塩素、ヨウ素又はジクロロメチルを表す。)

又は

Aは式(A3)の基を表し、

【0007】

【化31】



(式中、R¹³はC₁ - C₄ - アルキル又は1から5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロアルキルを表す。)

又は

Aは式(A4)の基を表し、

【0008】

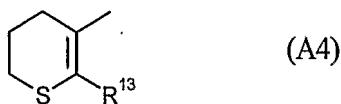
10

20

30

40

【化32】



(式中、R¹⁻³はC₁-C₄-アルキル又は1から5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロアルキルを表す。)

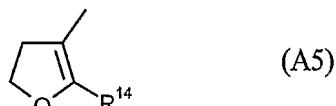
又は

Aは式(A5)の基を表し、

【0009】

10

【化33】



(式中、R¹⁻⁴はC₁-C₄-アルキル又は1から5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロアルキルを表す。)

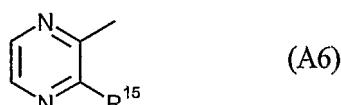
又は

Aは式(A6)の基を表し、

【0010】

20

【化34】



(式中、R¹⁻⁵は、水素、ハロゲン、C₁-C₄-アルキル又は1から5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロアルキルを表す。)

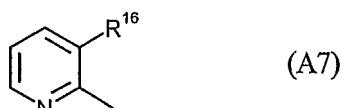
又は

Aは式(A7)の基を表し、

【0011】

30

【化35】



(式中、R¹⁻⁶は、ハロゲン、ヒドロキシル、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-アルキルチオ、各場合において1から5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-ハロアルキルチオ又はC₁-C₄-ハロアルコキシを表す。)

又は

Aは式(A8)の基を表し、

【0012】

40

【化36】



(式中、R¹⁻⁷はC₁-C₄-アルキルを表す。)

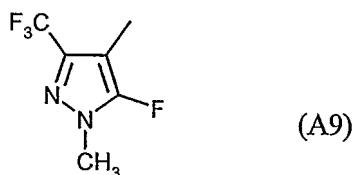
又は

50

A は式 (A9) の基を表し、

【0013】

【化37】

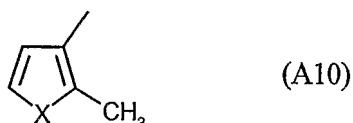


又は

A は式 (A10) の基を表し、

【0014】

【化38】



(式中、X は O (酸素) 又は S (硫黄) を表す。)

又は

A は式 (A11) の基を表す。

【0015】

【化39】



(式中、X は O (酸素) 又は S (硫黄) を表し、

R¹⁸ はヨウ素又はメチルを表す。)

30

本発明の化合物は、妥当な場合には、さまざまな可能な異性体、特に、例えば、E と Z、スレオとエリスロなどの立体異性体、光学異性体、妥当な場合には互変異性体の混合物として存在することができる。特許請求されるものは、2 個の E と Z 異性体の両方、スレオとエリスロ、光学異性体、これらの異性体の任意の混合物及び可能な互変異性体を表す。

【0016】

また、式 (I) のシリル化カルボキサミドは、

a) 式 (II) のカルボン酸誘導体が

【0017】

【化40】

40



(式中、

X¹ はハロゲン又はヒドロキシルを表し、

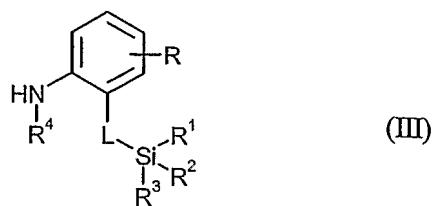
A は上で定義されたとおりを表す。)

妥当な場合には触媒の存在下で、妥当な場合には縮合剤の存在下で、妥当な場合には酸結合剤の存在下で、かつ妥当な場合には希釈剤の存在下で、式 (III) のアミンと反応し、

50

【0018】

【化41】

(式中、R、L、R¹、R²、R³及びR⁴は上で定義されたとおりを表す。)

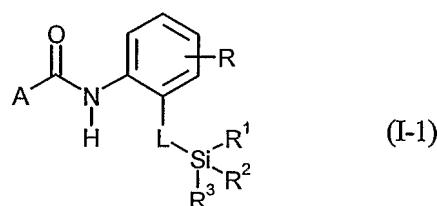
10

又は

b) 式(I-1)のシリル化カルボキサミドが、

【0019】

【化42】



20

(式中、R、L、R¹、R²、R³及びAは上で定義されたとおりを表す。)

塩基の存在下及び希釀剤の存在下で、式(VIII)のハロゲン化物と反応する

【0020】

【化43】



(式中、

X²は塩素、臭素又はヨウ素を表し、

30

R^{4a}は、C₁ - C₈ - アルキル、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁ - C₆ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルフィニル、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルホニル、ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル；ホルミル、ホルミル - C₁ - C₃ - アルキル、(C₁ - C₃ - アルキル)カルボニル - C₁ - C₃ - アルキル、(C₁ - C₃ - アルコキシ)カルボニル - C₁ - C₃ - アルキル；各場合において1から13個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するハロ - (C₁ - C₃ - アルキル)カルボニル - C₁ - C₃ - アルキル、ハロ - (C₁ - C₃ - アルコキシ)カルボニル - C₁ - C₃ - アルキル；

40

(C₁ - C₈ - アルキル)カルボニル、(C₁ - C₈ - アルコキシ)カルボニル、(C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル)カルボニル、(C₃ - C₈ - シクロアルキル)カルボニル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有する(C₁ - C₆ - ハロアルキル)カルボニル、(C₁ - C₆ - ハロアルコキシ)カルボニル、(ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル)カルボニル、(C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル)カルボニル；又は-C(=O)C(=O)R⁵、-CONR⁶R⁷若しくは-CH₂NR⁸R⁹を表し、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸及びR⁹は請求項1に定義されたとおりを表す。)

ときに得られることが見出された。

50

【0021】

最後に、式(I)の新規シリル化カルボキサミドは、きわめて良好な殺菌性を有し、作物の保護と材料の保護の両方において望ましくない微生物を抑制するために使用できることが見出された。

【0022】

式(I)は、本発明によるシリル化カルボキサミドの一般的定義である。上記及び下記の式の好ましい基の定義を以下に示す。これらの定義は、式(I)の最終生成物とすべての中間体の両方に適用される。

【0023】

Rは、好ましくは水素である。

10

【0024】

Rはさらに好ましくはフッ素であり、フッ素は、特に好ましくはアニリド基の4、5又は6位、さらに特に(very particularly)好ましくは4又は6位、とりわけ4位に位置する[上記式(I)参照]。

【0025】

Rはさらに好ましくは塩素であり、塩素は特に好ましくはアニリド基の5位に位置する[上記式(I)参照]。

【0026】

Rはさらに好ましくはメチルであり、メチルは特に好ましくはアニリド基の3位に位置する[上記式(I)参照]。

20

【0027】

Rはさらに好ましくはトリフルオロメチルであり、トリフルオロメチルは特に好ましくはアニリド基の4又は5位に位置する[上記式(I)参照]。

【0028】

Lは、好ましくは、直接結合であり、又は場合によってはハロゲン置換されていてよい直鎖若しくは分枝C₁ - C₆ - アルキレン、C₂ - C₆ - アルケニレン又はC₂ - C₆ - アルキニレンである。

【0029】

Lは、特に好ましくは、直接結合であり、又は-CH₂-、-(CH₂)₂-、-(CH₂)₃-、-CH(Me)-、-CH(Me)CH₂-、-CH₂CH(Me)-、-CH(Me)CH(Me)-、-CH(Me)CH₂-、-C(Me₂)CH₂-、-CH(Me)-(CH₂)₂-、-CH(Me)-(CH₂)₃-、-CH=CH-、-C(Me)=CH-若しくは-C=C-である。

30

【0030】

Lは、さらに特に好ましくは、-(CH₂)₂-、-(CH₂)₃-、-CH(Me)-、-CH(Me)CH₂-、-CH(Me)-(CH₂)₂-、-CH(Me)-(CH₂)₃-、-CH=CH-、-C(Me)=CH-又は-C=C-である。

【0031】

R¹及びR²は互いに独立に、好ましくは、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₃ - アルコキシ-C₁ - C₃ - アルキル又はC₁ - C₃ - アルキルチオ-C₁ - C₃ - アルキルである。

40

【0032】

R¹及びR²は互いに独立に、特に好ましくは、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、メチルチオメチル、エチルチオメチル、メチルチオエチル又はエチルチオエチルである。

【0033】

R¹及びR²は互いに独立に、さらに特に好ましくは、メチル、メトキシ、メトキシメチル又はメチルチオメチルである。

【0034】

R¹及びR²はとりわけ好ましくは各々メチルである。

50

【0035】

R^3 は、特に、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_3$ - アルコキシ - $C_1 - C_3$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - アルキルチオ - $C_1 - C_3$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、フェニル又はベンジルである。

【0036】

R^3 は、特に好ましくは、メチル、エチル、 n - 若しくはイソプロピル、 n - 、sec - 、イソ - 若しくはtert - プチル、メトキシ、エトキシ、 n - 若しくはイソプロポキシ、 n - 、sec - 、イソ - 若しくはtert - プトキシ、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、メチルチオメチル、エチルチオメチル、メチルチオエチル、エチルチオエチル、シクロプロピル、フェニル又はベンジルである。

10

【0037】

R^3 は、さらに特に好ましくは、メチル、エチル、 n - 若しくはイソプロピル、イソ - 若しくはtert - プチル、メトキシ、イソプロポキシ、イソ - 若しくはtert - プトキシ、メトキシメチル、メチルチオメチル又はフェニルである。

【0038】

R^3 は、とりわけ好ましくは、メチル、エチル、 n - 又はイソプロピル、イソ - 又はtert - プチル、メトキシ、イソプロポキシ、イソ - 又はtert - プトキシである。

【0039】

R^3 は最も好ましくはメチルである。

【0040】

20

R^4 は、好ましくは、水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ - アルコキシ - $C_1 - C_3$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルホニル、ハロ - $C_1 - C_3$ - アルコキシ - $C_1 - C_3$ - アルキル、 $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルキル；ホルミル、ホルミル - $C_1 - C_3$ - アルキル、($C_1 - C_3$ - アルキル)カルボニル - $C_1 - C_3$ - アルキル、($C_1 - C_3$ - アルコキシ)カルボニル - $C_1 - C_3$ - アルキル；各場合において1から13個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するハロ - ($C_1 - C_3$ - アルキル)カルボニル - $C_1 - C_3$ - アルキル、ハロ - ($C_1 - C_3$ - アルコキシ)カルボニル - $C_1 - C_3$ - アルキル、

30

($C_1 - C_6$ - アルキル)カルボニル、($C_1 - C_4$ - アルコキシ)カルボニル、($C_1 - C_3$ - アルコキシ - $C_1 - C_3$ - アルキル)カルボニル、($C_3 - C_6$ - シクロアルキル)カルボニル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有する($C_1 - C_4$ - ハロアルキル)カルボニル、($C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ)カルボニル、(ハロ - $C_1 - C_3$ - アルコキシ - $C_1 - C_3$ - アルキル)カルボニル、($C_3 - C_6$ - ハロシクロアルキル)カルボニル；又は - $C(=O)C(=O)R^5$ 、- $C\text{ON}R^6$ R^7 若しくは - $CH_2NR^8R^9$ である。

【0041】

40

R^{4a} は、特に好ましくは、水素、メチル、エチル、 n - 若しくはイソプロピル、 n - 、イソ - 、sec - 若しくはtert - プチル、ペンチル又はヘキシル、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、 n - 若しくはイソプロピルスルフィニル、 n - 、イソ - 、sec - 若しくはtert - プチルスルフィニル、メトキシメチル、メトキシエチル、エトキシメチル、エトキシエチル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメトキシメチル；ホルミル、- $CH_2 - CHO$ 、- (CH_2)₂ - CHO 、- $CH_2 - CO - CH_3$ 、- $CH_2 - CO - CH_2CH_3$ 、- $CH_2 - CO - CH(CH_3)$

50

CH_3)₂、 - (CH₂)₂ - CO - CH₃、 - (CH₂)₂ - CO - CH₂CH₃、 - (CH₂)₂ - CO - CH(CH₃)₂、 - CH₂ - CO₂CH₃、 - CH₂ - CO₂CH₂CH₃、 - CH₂ - CO₂CH(CH₃)₂、 - (CH₂)₂ - CO₂CH(CH₃)₂、 - CH₂ - CO - CF₃、 - CH₂ - CO - CCl₃、 - CH₂ - CO - CH₂CF₃、 - CH₂ - CO - CH₂CCl₃、 - (CH₂)₂ - CO - CH₂CF₃、 - (CH₂)₂ - CO - CH₂CCl₃、 - CH₂ - CO₂CH₂CF₃、 - CH₂ - CO₂CF₂CF₃、 - CH₂ - CO₂CH₂CCl₃、 - CH₂ - CO₂CCl₂CCl₃、 - (CH₂)₂ - CO₂CF₂CF₃、 - (CH₂)₂ - CO₂CH₂CCl₃、 - (CH₂)₂ - CO₂CCl₂CCl₃;

10

メチルカルボニル、エチルカルボニル、n-プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、tert-ブチルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル、シクロプロピルカルボニル；トリフルオロメチルカルボニル、トリフルオロメトキシカルボニル又は - C(=O)C(=O)R⁵、 - CONR⁶R⁷若しくは - CH₂NR⁸R⁹である。

【0042】

R⁴は、さらに特に好ましくは、水素、メチル、メトキシメチル、ホルミル、- CH₂-CHO、- (CH₂)₂-CHO、- CH₂-CO-CH₃、- CH₂-CO-CH₂CH₃、- CH₂-CO-CH(CH₃)₂、- C(=O)CHO、- C(=O)C(=O)CH₃、- C(=O)C(=O)CH₂OCH₃、- C(O)CO₂CH₃、- C(=O)CO₂CH₂CH₃である。

20

【0043】

R⁴はとりわけ好ましくは水素である。

【0044】

R⁵は、好ましくは、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₃-アルコキシ-C₁-C₃-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-ハロアルコキシ、ハロ-C₁-C₃-アルコキシ-C₁-C₃-アルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキルである。

30

【0045】

R⁵は、特に好ましくは、水素、メチル、エチル、n-又はイソプロピル、tert-ブチル、メトキシ、エトキシ、n-又はイソプロポキシ、tert-ブトキシ、メトキシメチル、シクロプロピル；トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシである。

【0046】

R⁶及びR⁷は互いに独立に、好ましくは、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₃-アルコキシ-C₁-C₃-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₄-ハロアルキル、ハロ-C₁-C₃-アルコキシ-C₁-C₃-アルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキルである。

40

【0047】

また、R⁶とR⁷はそれらが結合している窒素原子と一緒に、好ましくは、ハロゲン及びC₁-C₄-アルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基で場合によっては一置換から四置換されていてもよい、5又は6個の環原子を有する飽和複素環を形成し、該複素環は、酸素、硫黄及びNR¹⁰からなる群から選択される1又は2個のさらなる非隣接ヘテロ原子を含むことができる。

【0048】

R⁶及びR⁷は互いに独立に、特に好ましくは、水素、メチル、エチル、n-又はイソプロピル、n-、イソ-、sec-又はtert-ブチル、メトキシメチル、メトキシエチル、エトキシメチル、エトキシエチル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル；トリフルオロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロエチル、トリフルオロメト

50

キシメチルである。

【0049】

また、 R^6 及び R^7 は、それらが結合している窒素原子と一緒に、特に好ましくは、モルホリン、チオモルホリン及びピペラジンからなる群から選択される飽和複素環を形成し、該複素環は、フッ素、塩素、臭素及びメチルからなる群から選択される同一又は異なる置換基で場合によっては一置換から四置換されていてもよく、ピペラジンは第2の窒素原子上で R^{10} で置換することができる。

【0050】

R^8 及び R^9 は互いに独立に、水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ - ハロシクロアルキルである。

10

【0051】

また、 R^8 と R^9 がそれらが結合している窒素原子と一緒に、好ましくは、ハロゲン及び $C_1 - C_4$ - アルキルからなる群から選択される同一又は異なる置換基で場合によっては一置換又は多置換されていてもよい、5から6個の環原子を有する飽和複素環を形成し、該複素環は、酸素、硫黄及び NR^{10} からなる群から選択される1又は2個のさらなる非隣接ヘテロ原子を含むことができる。

【0052】

R^8 及び R^9 は互いに独立に、特に好ましくは、水素、メチル、エチル、 n - 又はイソプロピル、 n - 、イソ - 、sec - 又はtert - ブチル、メトキシメチル、メトキシエチル、エトキシメチル、エトキシエチル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル；トリフルオロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロエチル、トリフルオロメトキシメチルである。

20

【0053】

また、 R^8 及び R^9 は、それらが結合している窒素原子と一緒に、特に好ましくは、モルホリン、チオモルホリン及びピペラジンからなる群から選択される飽和複素環を形成し、該複素環は、フッ素、塩素、臭素及びメチルからなる群から選択される同一又は異なる置換基で場合によっては一置換から四置換されていてもよく、ピペラジンは第2の窒素原子上で R^{10} で置換することができる。

【0054】

30

R^{10} は好ましくは水素又は $C_1 - C_4$ - アルキルである。

【0055】

R^{10} は、特に好ましくは、水素、メチル、エチル、 n - 又はイソプロピル、 n - 、イソ - 、sec - 又はtert - ブチルである。

【0056】

Aは、好ましくは、上記A1、A2、A5又はA7基の1個である。

【0057】

Aはさらに好ましくはA6、A10又はA11である。Aは特に好ましくはA1基である。

【0058】

40

Aはさらに特に好ましくはA2基である。

【0059】

Aはさらに特に好ましくはA5基である。

【0060】

Aはさらに特に好ましくはA6基である。

【0061】

Aはさらに特に好ましくはA7基である。

【0062】

Aはさらに特に好ましくはA10基である。

【0063】

50

Aはさらに特に好ましくはA 1 1基である。

【0064】

R¹⁻¹は、好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシル、シアノ、C₁-C₄-アルキル、各場合において1から5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロアルキル、C₁-C₂-ハロアルコキシ又はC₁-C₂-ハロアルキルチオである。

【0065】

R¹⁻¹は、特に好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシル、シアノ、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ又はトリクロロメチルチオである。

【0066】

R¹⁻¹は、さらに特に好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル又はトリクロロメチルである。

【0067】

R¹⁻¹は、とりわけ好ましくは、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、ジフルオロメチル又はトリフルオロメチルである。

【0068】

R¹⁻²は好ましくはヨウ素である。

【0069】

R¹⁻²はさらに好ましくは塩素である。

【0070】

R¹⁻²はさらに好ましくはジクロロメチルである。

【0071】

R¹⁻³は、好ましくは、メチル、エチル又は1から5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロアルキルである。

【0072】

R¹⁻³は、特に好ましくは、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルである。

【0073】

R¹⁻³は、さらに特に好ましくは、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル又はトリクロロメチルである。

【0074】

R¹⁻⁴は、好ましくは、メチル、エチル又は1から5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロアルキルである。

【0075】

R¹⁻⁴は、特に好ましくは、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルである。

【0076】

R¹⁻⁴は、さらに特に好ましくは、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル又はトリクロロメチルである。

【0077】

R¹⁻⁴は、とりわけ好ましくは、メチル又はトリフルオロメチルである。

【0078】

R¹⁻⁵は、好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル又は1から5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロアルキルである。

【0079】

R¹⁻⁵は、特に好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル又はトリフルオロメチ

10

20

30

40

50

ルである。

【0080】

R^{1-6} は、好ましくは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシリ、 C_1-C_4 -アルキル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、各場合において1から5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有する C_1-C_2 -ハロアルキル又は C_1-C_2 -ハロアルコキシである。

【0081】

R^{1-6} は、特に好ましくは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、トリクロロメチルである。

10

【0082】

R^{1-6} は、さらに特に好ましくは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル又はトリクロロメチルである。

【0083】

R^{1-7} は、好ましくは、メチル、エチル、 n -プロピル又はイソプロピルである。

【0084】

R^{1-7} は、特に好ましくは、メチル又はエチルである。

【0085】

X は好ましくは O (酸素) である。

20

【0086】

X はさらに好ましくは S (硫黄) である。

【0087】

R^{1-8} は好ましくはヨウ素である。

【0088】

R^{1-8} はさらに好ましくはメチルである。

【0089】

また、式(I-1)の化合物が強調される。

【0090】

【化44】

30



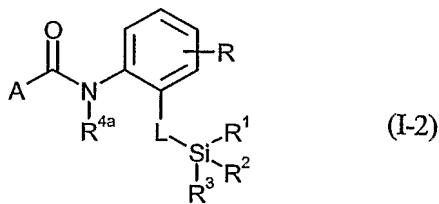
(式中、 R 、 L 、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び A は上で定義されたとおりである)

また、式(I-2)の化合物が強調される。

【0091】

40

【化45】



(式中、 R 、 L 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^{4a} 及び A は上で定義されたとおりである)

R^{4a} は、好ましくは、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、

50

$C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ - アルコキシ - $C_1 - C_3$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルホニル、ハロ - $C_1 - C_3$ - アルコキシ - $C_1 - C_3$ - アルキル、 $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルキル；ホルミル、ホルミル - $C_1 - C_3$ - アルキル、($C_1 - C_3$ - アルキル)カルボニル - $C_1 - C_3$ - アルキル、($C_1 - C_3$ - アルコキシ)カルボニル - $C_1 - C_3$ - アルキル；各場合において1から13個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するハロ - ($C_1 - C_3$ - アルキル)カルボニル - $C_1 - C_3$ - アルキル、ハロ - ($C_1 - C_3$ - アルコキシ)カルボニル - $C_1 - C_3$ - アルキル、

($C_1 - C_6$ - アルキル)カルボニル、($C_1 - C_4$ - アルコキシ)カルボニル、($C_1 - C_3$ - アルコキシ - $C_1 - C_3$ - アルキル)カルボニル、($C_3 - C_6$ - シクロアルキル)カルボニル；各場合において1から9個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有する($C_1 - C_4$ - ハロアルキル)カルボニル、($C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ)カルボニル、(ハロ - $C_1 - C_3$ - アルコキシ - $C_1 - C_3$ - アルキル)カルボニル、($C_3 - C_6$ - ハロシクロアルキル)カルボニル；又は - $C(=O)C(=O)R^5$ 、- $C(=O)R^6$ R^7 若しくは - $CH_2NR^8R^9$ であり、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 及び R^9 は上で定義されたとおりである。

【0092】

R^4 ^aは、特に好ましくは、メチル、エチル、 n - 若しくはイソプロピル、 n - 、イソ - 、sec - 若しくはtert - プチル、ペンチル又はヘキシル、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、 n - 若しくはイソプロピルスルフィニル、 n - 、イソ - 、sec - 若しくはtert - プチルスルフィニル、メチルスルホニル、エチルスルホニル、 n - 若しくはイソプロピルスルホニル、 n - 、イソ - 、sec - 若しくはtert - プチルスルホニル、メトキシメチル、メトキシエチル、エトキシメチル、エトキシエチル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメトキシメチル；ホルミル、- $CH_2 - CHO$ 、- $(CH_2)_2 - CHO$ 、- $CH_2 - CO - CH_3$ 、- $CH_2 - CO - CH_2CH_3$ 、- $CH_2 - CO - CH(CH_3)_2$ 、- $(CH_2)_2 - CO - CH_2CH_3$ 、- $(CH_2)_2 - CO - CH(CH_3)_2$ 、- $CH_2 - CO_2CH_3$ 、- $CH_2 - CO_2CH_2CH_3$ 、- $CH_2 - CO_2CH(CH_3)_2$ 、- $(CH_2)_2 - CO_2CH(CH_3)_2$ 、- $CH_2 - CO - CF_3$ 、- $CH_2 - CO - CCl_3$ 、- $CH_2 - CO - CH_2CF_3$ 、- $CH_2 - CO - C(H_2)CCl_3$ 、- $(CH_2)_2 - CO - CH_2CF_3$ 、- $(CH_2)_2 - CO - CH_2Cl$ 、- $CH_2 - CO_2CH_2CF_3$ 、- $CH_2 - CO_2CF_2CF_3$ 、- $CH_2 - CO_2CH_2CCl_3$ 、- $CH_2 - CO_2CCl_2CCl_3$ 、- $(CH_2)_2 - CO_2CH$ CF_3 、- $(CH_2)_2 - CO_2CF_2CF_3$ 、- $(CH_2)_2 - CO_2CH_2CCl_3$ 、- $(CH_2)_2 - CO_2CCl_2CCl_3$ ；

メチルカルボニル、エチルカルボニル、 n - プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、tert - プチルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、tert - プトキシカルボニル、シクロプロピルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、トリフルオロメトキシカルボニル又は - $C(-O)C(=O)R^5$ 、- $C(=O)R^6$ R^7 若しくは - $CH_2NR^8R^9$ であり、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 及び R^9 は上で定義されたとおりである。

【0093】

R^4 ^aは、さらに特に好ましくは、メチル、メトキシメチル、ホルミル、- $CH_2 - CHO$ 、- $(CH_2)_2 - CHO$ 、- $CH_2 - CO - CH_3$ 、- $CH_2 - CO - CH_2CH_3$ 、- $CH_2 - CO - CH(CH_3)_2$ 、- $C(=O)CHO$ 、- $C(=O)C(=O)$

10

20

30

40

50

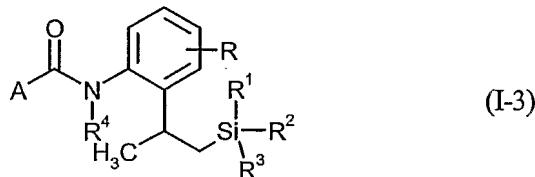
CH_3 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{OCH}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ である。

【0094】

また、式(I-3)の化合物が強調される。

【0095】

【化46】



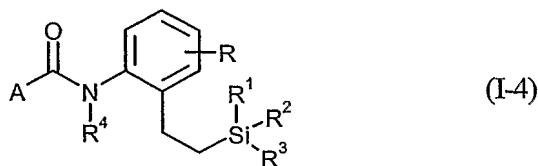
10

(式中、 R 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び A は上で定義されたとおりである)

また、式(I-4)の化合物が強調される。

【0096】

【化47】



20

(式中、 R 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び A は上で定義されたとおりである)

アルキル、アルケニルなどの飽和又は不飽和炭化水素基は、例えばアルコキシ中などのヘテロ原子との組み合わせを含めて、可能であれば、各場合において直鎖又は分枝とすることができる。

【0097】

場合によっては置換されていてもよい基は一置換又は多置換することができ、多置換の場合には置換基は同一でも異なっていてもよい。

【0098】

30

例えばハロアルキルなどのハロゲン置換された基はモノ又はポリハロゲン化される。ポリハロゲン化の場合には、ハロゲン原子は同一でも異なっていてもよい。ここで、ハロゲンとは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素、特にフッ素、塩素及び臭素である。

【0099】

一般的の基又は好ましい基の上記定義又は説明は、それぞれの範囲と好ましい範囲を所望のとおりに組み合わせることができる。これらの定義は、最終生成物と、それに対応して、前駆体及び中間体との両方に適用される。

【0100】

プロセス及び中間体の説明

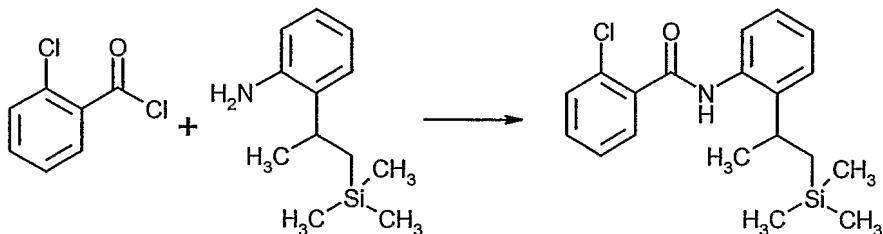
プロセス(a)

40

例えば塩化2-クロロベンゾイル及び{2-[1-メチル-2-(トリメチルシリル)エチル]フェニル}アミンを出発材料として用いて、本発明によるプロセス(a)の過程は下記式スキームによって説明することができる。

【0101】

【化48】



【0102】

10

式(II)は、本発明によるプロセス(a)を実施するための出発材料として必要とされるカルボン酸誘導体の一般的定義である。この式(II)においては、Aは、好ましくは、特に好ましくは、さらに特に好ましくは、本発明による式(I)の化合物の説明に関連して、これらの基に対してそれぞれ好ましい、特に好ましい、さらに特に好ましいとしてすでに述べられた意味を有する。X¹は好ましくは塩素、臭素又はヒドロキシルを指す。

【0103】

式(II)のカルボン酸誘導体は公知であり、及び/又は公知の方法によって得ることができる(国際公開第93/11117号、EP-A 0 545 099、EP-A 0 589 301、EP-A 0 589 313及びDE-A 103 25 43 9.0参照)。

20

【0104】

式(III)は、本発明によるプロセス(a)を実施するための出発材料としてさらに必要とされるアミンの一般的定義である。この式(III)においては、R、L、R¹、R²、R³及びR⁴は、好ましくは、特に好ましくは、さらに特に好ましくは、本発明による式(I)の化合物の説明に関連して、これらの基に対してそれぞれ好ましい、特に好ましい、さらに特に好ましいとしてすでに述べられた意味を有する。

【0105】

式(III)のアミンは公知であり、及び/又は公知の方法によって得ることができる(国際公開第03/080628号及び調製実施例参照)。

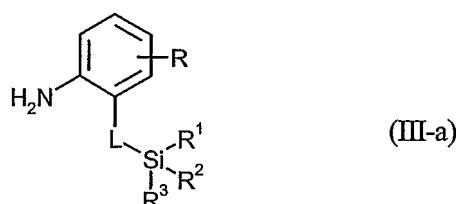
30

【0106】

R⁴が水素ではない式(III)のアミンは、例えば式(III-a)のアミンを式(VIII)のハロゲン化物と反応させることによって得ることができる。[本発明によるプロセス(b)の反応条件がそれに応じて適用される]

【0107】

【化49】



40

(式中、R、L、R¹、R²及びR³は上で定義されたとおりである)

【0108】

【化50】



(式中、X²及びR^{4a}は上で定義されたとおりである)

【0109】

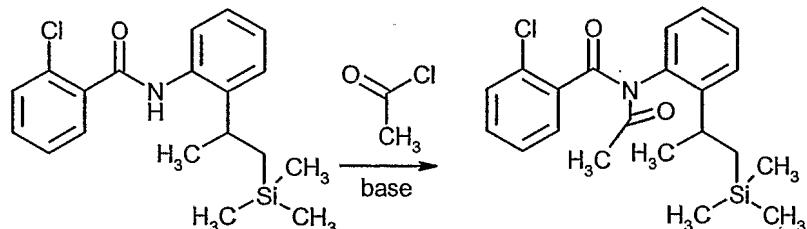
50

プロセス (b)

2-クロロ-N-[2-[1-メチル-2-(トリメチルシリル)エチル]フェニル]ベンズアミド及び塩化アセチルを出発材料として用いて、本発明によるプロセス (b) の過程は下記式スキームによって説明することができる。

【0110】

【化51】



10

【0111】

式 (I-1) は、本発明によるプロセス (b) を実施するための出発材料として必要とされるシリル化カルボキサミドの一般的定義である。この式 (I-1) においては、R、L、R¹、R²、R³、R⁴ 及びAは、好ましくは、特に好ましくは、さらに特に好ましくは、本発明による式 (I) の化合物の説明に関連して、これらの基に対してそれぞれ好ましい、特に好ましい、さらに特に好ましいとしてすでに述べられた意味を有する。

20

【0112】

式 (I-1) の化合物は、本発明の化合物であり、プロセス (a) によって調製することができる。

反応条件

本発明によるプロセス (a) の実施に適切な希釈剤はすべての不活性有機溶媒である。これらは、好ましくは、例えば、石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレン、デカリンなどの脂肪族、脂環式又は芳香族炭化水素；例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、トリクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルt-ブチルエーテル、メチルt-エチルアミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、1,2-ジエトキシエタン、アニソールなどのエーテル；アセトニトリル、プロピオニトリル、n-又はi-ブチロニトリル、ベンゾニトリルなどのニトリル；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチルホルムアニリド、N-メチルピロリドン、ヘキサメチルリン酸トリアミドなどのアミド；水又は純水とそれらの混合物などである。

30

【0113】

本発明によるプロセス (b) の実施に適切な希釈剤はすべての不活性有機溶媒である。これらは、好ましくは、例えば、石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレン、デカリンなどの脂肪族、脂環式又は芳香族炭化水素；例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、トリクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルt-ブチルエーテル、メチルt-エチルアミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、1,2-ジエトキシエタン、アニソールなどのエーテル；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチルホルムアニリド、N-メチルピロリドン、ヘキサメチルリン酸トリアミドなどのアミドなどである。本発明によるプロセス (a) は、妥当な場合には、適切な酸受容体の存在下で実施される。適切な酸受容体は、すべての通常の無機又は有機塩基である。これらは、好ましくは、例えば、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、リチウムジイソプロピルアミド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエ

40

50

トキシド、カリウムtert-ブトキシド、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸アンモニウムなどのアルカリ土類金属又はアルカリ金属水素化物、水酸化物、アミド、アルコキシド、酢酸塩、炭酸塩、炭酸水素塩などであり、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジメチルベンジルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、N-メチルモルホリン、N,N-ジメチルアミノピリジン、ジアザビシクロオクタン(DABCO)、ジアザビシクロノネン(DBN)、ジアザビシクロウンデセン(DBU)などの第三級アミンなどである。

【0114】

10

本発明によるプロセス(b)は適切な塩基の存在下で実施される。適切な塩基は、すべての通常の無機又は有機塩基である。これらは、好ましくは、例えば、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、リチウムジイソプロピルアミド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシド、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウム、酢酸アンモニウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化アンモニウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸セシウムなどのアルカリ土類金属又はアルカリ金属水素化物、水酸化物、アミド、アルコキシド、酢酸塩、炭酸塩、炭酸水素塩などであり、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジメチルベンジルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、N-メチルモルホリン、N,N-ジメチルアミノピリジン、ジアザビシクロオクタン(DABCO)、ジアザビシクロノネン(DBN)、ジアザビシクロウンデセン(DBU)などの第三級アミンなどである。

【0115】

20

本発明によるプロセス(a)は、妥当な場合には、適切な縮合剤の存在下で実施される。適切な縮合剤は、かかるアミド化反応に通常使用されるすべての縮合剤である。ホスゲン、三臭化リン、三塩化リン、五塩化リン、オキシ塩化リン、塩化チオニルなどの酸ハロゲン化物形成剤(former)；クロロギ酸エチル、クロロギ酸メチル、クロロギ酸イソプロピル、クロロギ酸イソブチル、塩化メタンスルホニルなどの無水物形成剤；N,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)などのカルボジイミド又は五酸化リン、ポリリン酸、N,N'-カルボニルジイミダゾール、2-エトキシ-N-エトキシカルボニル-1,2-ジヒドロキノリン(EDQ)、トリフェニルホスフィン/四塩化炭素、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などの他の通常の縮合剤を例として挙げることができる。

【0116】

30

本発明によるプロセス(a)は、妥当な場合には、触媒の存在下で実施される。例としては、4-ジメチルアミノピリジン、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール又はジメチルホルムアミドを挙げることができる。

【0117】

40

本発明によるプロセス(a)を実施するときには、反応温度は比較的広い範囲内で変えることができる。一般に、このプロセスは、0から150、好ましくは0から120、特に好ましくは10から80の温度で実施される。

【0118】

本発明によるプロセス(b)を実施するときには、反応温度は比較的広い範囲内で変えることができる。一般に、このプロセスは、0から150、好ましくは20から110の温度で実施される。

【0119】

式(I)の化合物を調製するための本発明によるプロセス(a)を実施する場合には、式(II)のカルボン酸誘導体1モルにつき、式(III)のアミンの一般に0.8から1.5mol、好ましくは0.8から8mol及び酸結合剤の1から3molが使用される。

50

【0120】

本発明によるプロセス(b)を実施する場合には、式(I - 1)のシリル化カルボキサミド 1 モルにつき、式(a)のハロゲン化合物の一般に 0.2 から 5 mol 、好ましくは 0.5 から 2 mol が使用される。

【0121】

特段の記載がない限り、本発明による全プロセスは一般に大気圧下で実施される。しかし、高圧又は低圧下、一般に 0.1 バール(10 kPa)から 10 バール(1 MPa)で操作することもできる。

【0122】

本発明の化合物は、強力な殺菌活性を有し、作物の保護及び材料の保護における真菌、細菌などの望ましくない微生物を抑制するために使用することができる。

10

【0123】

殺真菌剤は、作物の保護においてネコブカビ綱、卵菌綱、ツボカビ綱、接合菌綱、子囊菌綱、担子菌綱及び不完全菌綱を抑制するために使用することができる。

【0124】

殺菌剤は、作物の保護においてシュードモナス科、リゾビウム科、腸内細菌科、コリネバクテリア科及びストレプトミセス科を抑制するために使用することができる。

【0125】

上記属名で分類される真菌性及び細菌性疾患を引き起こす一部の病原体を例としてあげることができるが、これらだけに限定されない。

20

【0126】

例えばザントモナス カンペストリス pv. オリゼエ(*Xanthomonas campesstris* pv. *oryzae*)などのザントモナス(*Xanthomonas*)種；

例えばシュードモナス シリング pv. ラクリマンス(*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*)などのシュードモナス(*Pseudomonas*)種；

例えばエルウィニア アミロボーラ(*Erwinia amylovora*)などのエルウィニア(*Erwinia*)種；

例えばピシウム ウルチマム(*Pythium ultimum*)などのピシウム(*Pythium*)種；

30

例えばフィトフトラ インフェスタンス(*Phytophthora infestans*)などのフィトフトラ(*Phytophthora*)種；

例えばシュードペロノスポラ フムリ(*Pseudoperonospora humuli*)、シュードペロノスポラ クベンシス(*Pseudoperonospora cubensis*)などのシュードペロノスポラ(*Pseudoperonospora*)種；

例えばプラスモバラ ビチコラ(*Plasmopara viticola*)などのプラスモバラ種；

例えばブレミア ラクトカエ(*Bremia lactucae*)などのブレミア(*Bremia*)種；

40

例えばペロノスポラ ピシ(*Peronospora pisii*)、P. ブラシカエ(*P. brassicae*)などのペロノスポラ(*Peronospora*)種；

例えばエリシフェ グラミニス(*Erysiphe graminis*)などのエリシフェ(*Erysiphe*)種；

例えばスファエロセカ フリギネア(*Sphaerotilotheca fuliginea*)などのスファエロセカ(*Sphaerotilotheca*)種；

例えばポドスファエラ ロイコトリカ(*Podosphaera leucotricha*)などのポドスファエラ種(*Podosphaera*)種；

例えばベンチュリア イナエクアリス(*Venturia inaequalis*)な

50

どのベンチュリア (*Venturia*) 種；

例えればピレノフォラ テレス (*Pyrenophora teres*)、*P. グラミネア* (*P. guraminea*) などのピレノフォラ (*Pyrenophora*) 種

(分生子の形態：ドレクスレラ、同義：ヘルミントスボリウム)；

例えればコクリオボラス サティブス (*Cochliobolus sativus*) などのコクリオボラス (*Cochliobolus*) 種

(分生子の形態：ドレクスレラ、同義：ヘルミントスボリウム)；

例えればウロミセス アベンジクラタス (*Uromyces appendiculatus*) などのウロミセス (*Uromyces*) 種；

例えればプクキニア レコンジタ (*Puccinia recondita*) などのプクキニア (*Puccinia*) 種； 10

例えればスクレロチニア スクレロチオラム (*Sclerotinia sclerotiorum*) などのスクレロチニア (*Sclerotinia*) 種；

例えればティレチア カリエス (*Tilletia caries*) などのティレチア (*Tilletia*) 種；

例えればウスチラゴ ヌダ (*Ustilago nuda*)、ウスチラゴ アベナエ (*Ustilago avenae*) などのウスチラゴ (*Ustilago*) 種；

例えればペリキュラリア ササキイ (*Pellicularia sasakii*) などのペリキュラリア (*Pellicularia*) 種；

例えればピリキュラリア オリザエ (*Pyricularia oryzae*) などのピリキュラリア (*Pyricularia*) 種； 20

例えればフザリウム カルモラム (*Fusarium culmorum*) などのフザリウム (*Fusarium*) 種；

例えればボトリティス シネレア (*Botrytis cinerea*) などのボトリティス (*Botrytis*) 種；

例えればセプトリア ノドラム (*Septoria nodorum*) などのセプトリア (*Septoria*) 種；

例えればレプトスファエリア ノドラム (*Leptosphaeria nodorum*) などのレプトスファエリア (*Leptosphaeria*) 種；

例えればセルコスボラ カネセンス (*Cercospora canescens*) などのセルコスボラ (*Cercospora*) 種； 30

例えればアルテルナリア ブラシカエ (*Alternaria brassicace*) などのアルテルナリア (*Alternaria*) 種；及び

例えればシュードセルコスボレラ ヘルボトリコイデス (*Pseudocercospora herpotrichoides*) などのシュードセルコスボレラ (*Pseudocercospora*) 種。

【0127】

例えればリゾクトニア ソラニ (*Rhizoctonia solani*) などのリゾクトニア (*Rhizoctonia*) 種。

【0128】

本発明の活性化合物は、植物において強力な強化作用も示す。したがって、本発明の活性化合物は、望ましくない微生物による攻撃に対する植物内部の防御を動員するのに適切である。

【0129】

本明細書において、植物強化（耐性誘導）化合物とは、処理を施された植物が、処理後に望ましくない微生物を接種されたときに、これらの微生物に対して実質的な耐性を示すように、植物の防御系を刺激することができる物質を意味するものと理解される。

【0130】

本明細書において、望ましくない微生物とは、植物病原性の真菌、細菌及びウイルスを意味するものと理解される。したがって、本発明の化合物は、処理後に、前記病原体によ 50

る攻撃から植物を一定期間防御するために使用することができる。防御期間は、一般に、本活性化合物による植物の処理後1日から10日、好ましくは1日から7日である。

【0131】

本活性化合物は、植物の病気を抑制するために必要とされる濃度で植物が十分な耐容性を示すことから、植物の地上部分、繁殖株及び種子並びに土壤の処理が可能である。

【0132】

本発明の活性化合物は、例えばブクキニア種に対してなど穀類の病気を抑制するのに、また、例えばボトリティス、ベンチュリア又はアルテルナリア種に対してなどブドウ栽培、果実栽培及び野菜栽培における病気を抑制するのに特に良好な結果で使用することができる。

10

【0133】

本発明の活性化合物は作物の収率向上にも適切である。また、本発明の活性化合物は毒性が低く、植物の耐容性が良好である。

【0134】

本発明の活性化合物は、妥当な場合には、ある濃度及び散布量で、除草剤として、植物の成長を調節するために、また、有害動物を抑制するために使用することもできる。本発明の活性化合物は、妥当な場合には、他の活性化合物の合成における中間体又は前駆体として使用することもできる。

【0135】

本発明によれば、すべての植物及び植物の部分を処理することができる。本明細書では植物とは、望ましい野草、望ましくない野草、(天然作物を含めた)作物などのすべての植物及び植物群を意味すると理解される。作物は、トランスジェニック植物及び植物育種家の権利によって保護され得る若しくは保護され得ない植物品種を含めて、従来の品種改良と最適化法によって、生物工学的方法及び遺伝子工学的方法によって、又はこれらの方法の組み合わせによって取得できる植物とすることができる。植物の部分とは、芽、葉、花、根などの地上及び地下にある植物のあらゆる部分及び器官を意味するものと理解され、その例としては、葉、針葉、茎、幹、花、子実体、果実及び種を挙げることができ、根、塊茎、地下茎を挙げることもできる。植物の部分には、採取された物質、栄養繁殖物質及び生殖物質、例えば、実生、塊茎、地下茎、切り枝及び種も含まれる。

20

【0136】

本活性化合物を用いた本発明による植物及び植物の部分の処理は、直接実施され、又は通常の処理法、例えば、浸漬、噴霧、蒸発、微粒化、散布、ブラッシングによって、増殖物質の場合、特に種子の場合には、さらに単層若しくは多層コーティングによって、それらの環境、生育地若しくは保存場所に作用させることにより実施される。

30

【0137】

材料の保護においては、本発明の化合物は、望ましくない微生物による感染及び破壊から工業材料を保護するために使用することができる。

【0138】

本明細書における工業材料とは、工業で使用するために調製された非生物材料を意味すると理解される。例えば、微生物による変化又は破壊から本発明の活性化合物によって保護しようとされる工業材料は、粘着付与剤、サイズ、紙及びボール紙、布地、皮革、木、塗料及びプラスチック製品、冷却用潤滑剤並びに微生物に感染され又は微生物によって破壊され得る他の材料とすることができます。生産工場の一部、例えば、微生物の増殖によって損傷され得る冷却水路も、保護すべき材料の範囲内とすることができます。本発明の範囲内とすることができますの工業材料は、好ましくは、粘着付与剤、サイズ、紙及びボール紙、皮革、木、塗料、冷却用潤滑剤並びに熱媒液であり、特に好ましくは木である。

40

【0139】

工業材料を分解又は変化させることができる微生物は、例えば、細菌、真菌、酵母、藻類及び粘液生物(slime organism)である。本発明の活性化合物は、好ましくは、真菌、特にカビ、木材脱色及び木材破壊真菌(担子菌綱)並びに粘液生物及び藻

50

類に対して作用する。

【0140】

以下の属の微生物を例として挙げることができる。

【0141】

アルテルナリア テニュイス (*Alternaria tenuis*) などのアルテルナリア属、

アスペルギルス ニガー (*Aspergillus niger*) などのアスペルギルス属、

ケトミウム グロボサム (*Chaetomium globosum*) などのケトミウム属、

カニオフォラ プエタナ (*Coniophora puetana*) などのカニオフォラ属、

レンチナス チグリヌス (*Lentinus tigrinus*) などのレンチナス属、

ペニシリウム グラウカム (*Penicillium glaucum*) などのペニシリウム属、

ポリポラス バージカラ (*Polyporus versicolor*) などのポリポラス属、

オーレオバシジウム プルランス (*Aureobasidium pullulans*) などのオーレオバシジウム属、

スクレロフォーマ ピティオフィラ (*Sclerophoma pityophila*) などのスクレロフォーマ属、

トリコデルマ ビリデ (*Trichoderma viride*) などのトリコデルマ属、

エシェリキア コリ (*Escherichia coli*) などのエシェリキア属、

シュードモナス エルジノーサ (*Pseudomonas aeruginosa*) などのシュードモナス属、及び

スタフィロコッカス アウレウス (*Staphylococcus aureus*) などのスタフィロコッカス属。

【0142】

活性化合物は、それらの個々の物理的及び/又は化学的諸性質に応じて、溶液、乳濁液、懸濁液、粉末、泡、ペースト、顆粒、エアゾール、シード用高分子物質中及びコーティング組成物中のマイクロカプセル並びにUV冷及び温噴霧剤などの通常の製剤に転化することができる。

【0143】

これらの製剤は公知の方法で、例えば、活性化合物を增量剤、すなわち液体溶媒、加圧液化ガス及び/又は固体担体と混合し、界面活性剤、すなわち乳化剤及び/又は分散剤、及び/又は発泡剤を場合によっては使用することによって製造される。使用される增量剤が水の場合には、補助溶媒として例えば有機溶媒を使用することもできる。基本的に、適切な液体溶媒は、キシレン、トルエン、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、塩化メチレンなどの塩素化芳香族化合物若しくは塩素化脂肪族炭化水素、シクロヘキサン、パラフィンなどの脂肪族炭化水素、例えば、石油留分、ブタノール、グリコールなどのアルコール並びにそれらのエーテル及びエステル、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、シクロヘキサンなどのケトン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドなどの強い極性溶媒又は水である。液化ガス状增量剤又は担体とは、標準温度及び大気圧下においてガス状である液体、例えば、ハロゲン化炭化水素などのエアゾール噴霧剤又はブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素を意味すると理解される。適切な固相担体は、例えば、カオリン、クレイ、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モントモリロナイト、けい藻土などの土壤の天然鉱物及び微粉シリカ、アルミナ、シリカートなどの土壤の合成鉱物である。顆粒に適した固相担体は、

10

20

30

40

50

例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石、ドロマイトなどの粉碎、分級された天然の岩又は無機及び有機粗びき粉の合成顆粒並びにおがくず、ヤシ殻、トウモロコシの穂軸、タバコの茎などの有機材料の顆粒である。適切な乳化剤及び/又は発泡剤は、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、アルキルスルホナート、硫酸アルキル、アリールスルホナート、タンパク水解物などの非イオン性及び陰イオン性乳化剤である。適切な分散剤は、例えば、リグノサルファイト廃液及びメチルセルロースである。

【0144】

カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、ポリ酢酸ビニルなど粉末、顆粒又はラテックスの形の天然及び合成ポリマー、ケファリン及びレシチンなどの天然リン脂質、合成リン脂質などの粘着付与剤を前記製剤に使用することができる。他の可能な添加物は鉱物及び植物油である。

10

【0145】

無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタン及びブルシアンブルー、アリザリン染料、アゾ染料、金属フタロシアニン染料などの有機染料などの着色剤並びに鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデン及び亜鉛の各塩などの微量栄養素を使用することができる。

【0146】

前記製剤は、一般に、活性化合物の0.1から95重量%、好ましくは0.5から90%を含む。

20

【0147】

本発明の活性化合物はそのまま又は製剤中で、例えば、活性スペクトルを広げるため又は耐性の発生を防止するために、公知の殺真菌剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺虫剤との混合物として使用することもできる。多くの場合において相乗効果が得られ、すなわち、混合物の活性は個々の成分の活性よりも大きい。

【0148】

適切な混合成分は、例えば以下の化合物である。

殺真菌剤：

2-フェニルフェノール；8-ヒドロキシキノリン硫酸塩；アシベンゾラル-S-メチル；アルジモルフ；アミドフルメト；アンプロピルフォス(ampropylf os)；アンプロピルフォス-カリウム(ampropylf os-potassium)；アンドプリム(andopr im)；アニラジン；アザコナゾール；アゾキシストロビン；ベナラキシル；ベノダニル；ベノミル；ベンチアバリカルブ-イソプロピル；ベンズアマクリル(benzamacril)；ベンズアマクリル-イソブチル(benzamacr il-isobutyl)；ビラナフォス(bilanaf os)；ビナパクリル；ビフェニル；ビテルタノール；プラスチシジン-S；プロムコナゾール；ブピリメート；ブチオベート；ブチルアミン；多硫化カルシウム；カプシマイシン(capsimycin)；カプタホール；キャプタン；カルベンダジム；カルボキシン；カルプロパミド；カルボン；キノメチオネット；クロベンチアゾン(chlobenthiazone)；クロルフェナゾール(chlorfenazole)；クロロネブ；クロロタロニル；クロゾリネット；クロジラコン；シアゾファミド；シフルフェナミド；シモキサニル；シプロコナゾール；シプロジニル；シプロフラム；ダガーG(Dagger G)；デバカルブ(debacarb)；ジクロフルアニド；ジクロン；ジクロロフェン；ジクロシメット；ジクロメジン；ジクロラン；ジエトフェンカルブ；ジフェノコナゾール；ジフルメトリム；ジメチリモール；ジメトモルフ；ジモキシストロビン；ジニコナゾール；ジニコナゾール-M；ジノカップ；ジフェニルアミン；ジピリチオン；ジタリムホス；ジチアノン；ドジン；ドラゾキソロン；エジフェンホス；エポキシコナゾール；エタボキサム；エチリモール；エトリジアゾール；ファモキサドン；フェナミド；フェナパニル(fenapanil)；フェナリモル；フェンブコナゾール；フェンフラム；フェンヘキサミド；フェニトロパン(fenitropan)；フェノキサニル；フェンピクロニル；フェンプロピ

30

40

50

ジン；フェンプロピモルフ；フェルバム；フルアジナム；フルベンジミン；フルジオキソニル；フルメトバー(*f l u m e t o v e r*)；フルモルフ(*f l u m o r p h*)；フルオルイミド；フルオキサストロビン；フルキンコナゾール；フルルプリミドール；フルシラゾール；フルスルファミド；フルトラニル；フルトリアホール；ホルペット；ホセチル- A 1 ；ホセチル- ナトリウム；フベリダゾール；フララキシル；フラメトピル；フルカルバニル；フルメシクロックス；グアザチン；ヘキサクロロベンゼン；ヘキサコナゾール；ヒメキサゾール；イマザリル；イミベンコナゾール；イミノクタジントリアセタート；イミノクタジントリス(アルベシル)(*i m i n o c t a d i n e t r i s (a l b e s i l)*)；ヨードカルブ(*i o d o c a r b*)；イブコナゾール；イブロベンホス；イブロジオン；イブロバリカルブ；イルママイシン；イソプロチオラン；イソバレジオン(*i s o v a l e d i o n e*)；カスガマイシン；クレソキシムメチル；マンコゼブ；マネブ；メフェリムゾン；メパニピリム；メプロニル；メタラキシル；メタラキシル- M ；メトコナゾール；メタスルホカルブ；メトフロキサム；メチラム；メトミノストロビン；メトスルフォバックス；ミルディオマイシン；ミクロブタニル；ミクロゾリン；ナタマイシン；ニコビフェン(*n i c o b i f e n*)；ニトロタールイソプロピル；ノビフルムロン；ヌアリモル；オフレース；オリサストロビン；オキサジキシル；オキソリン酸；オキスポコナゾール；オキシカルボキシン；オキシフェンチイン(*o x y f e n t h i i n*)；パクロブトラゾール；ペフラゾエート；ベンコナゾール；ベンシクロン；ホスダイフェン；フタリド；ピコキシストロビン；ピペラリン；ポリオキシン；ポリオキソリム(*p o l y o x o r i m*)；プロベナゾール；プロクロラズ；プロシミドン；プロパモカルブ；プロパノシン- ナトリウム(*p r o p a n o s i n e - s o d i u m*)；プロピコナゾール；プロピネブ；プロキナジド；プロチオコナゾール；ピラクロストロビン；ピラゾホス；ピリフェノックス；ピリメタニル；ピロキロン；ピロキシファー(*p y r o x y f u r*)；ピロールニトリン；キンコナゾール(*q u i n c o n a z o l e*)；キノキシフェン；キントゼン；シメコナゾール；スピロキサミン；硫黄；テブコナゾール；テクロフタラム；テクナゼン；テトシクラシス；テトラコナゾール；チアベンダゾール；チシオフェン；チフルザミド；チオファネートメチル；チラム；チオキシミド(*t i o x y m i d*)；トルクロホスメチル；トリルフルアニド；トリアジメホン；トリアジメノール；トリアズブチル(*t r i a z b u t i l*)；トリアゾキシド(*t r i a z o x i d e*)；トリシクラミド(*t r i c y c l a m i d e*)；トリシクラゾール；トリデモルフ；トリフロキシストロビン；トリフルミゾール；トリホリン；トリチコナゾール；ウニコナゾール(*u n i c o n a z o l e*)；バリダマイシン A ；ビンクロゾリン；ジネブ；ジラム；ゾキサミド；(2 S) - N - [2 - [4 - [[3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - プロピニル] オキシ] - 3 - メトキシフェニル] エチル] - 3 - メチル - 2 - [(メチルスルホニル) アミノ] ブタナミド；1 - (1 - ナフタレニル) - 1 H - ピロール - 2 , 5 - ジオン；2 , 3 , 5 , 6 - テトラクロロ - 4 - (メチルスルホニル) ピリジン；2 - アミノ - 4 - メチル - N - フェニル - 5 - チアゾールカルボキサミド；2 - クロロ - N - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 1 H - インデン - 4 - イル - 3 - ピリジンカルボキサミド；3 , 4 , 5 - トリクロロ - 2 , 6 - ピリジンジカルボニトリル；アクチノベート(*a c t i n o v a t e*)；シス - 1 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾル - 1 - イル) シクロヘプタノール；メチル 1 - (2 , 3 - ジヒドロ - 2 , 2 - ジメチル - 1 H - インデン - 1 - イル) - 1 H - イミダゾール - 5 - カルボキシラート；炭酸モノカリウム；N - (6 - メトキシ - 3 - ピリジニル) - シクロプロパンカルボキサミド；N - ブチル - 8 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - 1 - オキサスピロ [4 . 5] デカン - 3 - アミン；テトラチオ炭酸ナトリウム；並びにボルドー液；水酸化銅；ナフテン酸銅、オキシ塩化銅；硫酸銅；クフラネブ；酸化銅；マンコッパー；オキシン銅などの銅塩及び調製物。

殺菌剤：

プロノポール、ジクロロフェン、ニトラピリン、ニッケルジメチルジチオカルバメート、カスガマイシン、オクチリノン、フランカルボン酸、オキシテトラサイクリン、プロベ

ナゾール、ストレプトマイシン、テクロフタラム、硫酸銅及びその他の銅調製物。

殺虫剤 / 殺ダニ剤 / 殺線虫剤 :

アバメクチン、A B G - 9 0 0 8、アセフェート、アセキノシル、アセタミブリド、アセトプロール、アクリナトリン、A K D - 1 0 2 2、A K D - 3 0 5 9、A K D - 3 0 8 8、アラニカルブ、アルジカルブ、アルドキシカルブ、アレスリン、アレスリン1R - 異性体、アルファ - シペルメトリン (アルファメトリン)、アミドフルメト、アミノカルブ、アミトラズ、アベルメクチン、A Z - 6 0 5 4 1、アザジラクチン、アザメチホス、アジンホスメチル、アジンホスエチル、アゾシクロチン、バチルス ポピリエ (*Bacillus popilliae*)、バチルス スフェリカス (*Bacillus sphaericus*)、バチルス サブチリス (*Bacillus subtilis*)、バチルス チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*)、バチルス チューリングエンシス系統 E G - 2 3 4 8、バチルス チューリングエンシス系統 G C - 9 1、バチルス チューリングエンシス系統 N C T C - 1 1 8 2 1、バキュロウイルス、ボーベリア バッシアナ (*Beauveria bassiana*)、ボーベリア テネラ (*Beauveria tenella*)、ベンダイオカルブ、ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ベンゾキシメート、ベータ - シフルトリン、ベータ - シペルメトリン、ビフェナゼート、ビフェントリン、ビナパクリル、ビオアレトリン、ビオアレトリン - S - シクロベンチル異性体、ビオエタノメトリン (*bioethanomethrin*)、ビオペルメトリン (*biopermethrin*)、ビオレスメトリン、ビストリフルロン、B P M C、ブロフェンプロックス (*brofenprox*)、ブロモホス - エチル、ブロモプロピラート、ブロムフェンビンホス (-メチル) (*bromfenvinfos* (-m ethyl))、B T G - 5 0 4、B T G - 5 0 5、ブフェンカルブ (*bufencarb*)、ブプロフェジン、ブタチオホス、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、ブチルピリダベン、カズサホス、カンフェクロル、カルバリル、カルボフラン、カルボフェノチオン、カルボスルファン、カルタップ、C G A - 5 0 4 3 9、キノメチオネット、クロルデン、クロルジメホルム、クロエトカルブ、クロルエトキシホス、クロルフェナピル、クロルフェンビンホス、クロルフルアズロン、クロルメホス、クロロベンジレート、クロロピクリン、クロルプロキシフェン (*chlорproxyfen*)、クロルピリホスメチル、クロルピリホス (-エチル)、クロバポルスリン (*chlорапортрин*)、クロマフェノジド、シス - シペルメトリン、シス - レスマトリン、シス - ペルメトリン、クロシトリン (*clocythrin*)、クロエトカルブ、クロフェンテジン、クロチアニジン、クロチアゾベン (*clothiazoben*)、コドレモン (*codlemone*)、クマホス (*coumaphos*)、シアノフェンホス、シアノホス、シクロブレン (*cyclopren*)、シクロプロトリン、コドリンガ (*Cydia pomonella*)、シフルトリン、シハロトリン、シヘキサチン、シペルメトリン、シフェノトリン (1R - トランス - 異性体)、シロマジン、DDT、デルタメトリン、デメトン - s - メチル、デメトン - s - メチルスルホン、ジアフェンチウロン、ジアリホス、ダイアジノン、ジクロフェンチオン、ジクロルホス、ジコホール、ジクロトホス、ジシクラニル、ジフルベンズロン、ジメトエート、ジメチルビンホス、ジノブトン、ジノカップ、ジノテフラン、ジオフェノラン、ジスルホトン、ドキュセートナトリウム、ドフェナピン (*dofenapyn*)、D O W C O - 4 3 9、エフルシラナート (*eflusilante*)、エマメクチン、エマメクチンベンゾアート、エムペントリン (1R - 異性体)、エンドスルファン、エントモブソラ (*Entomophthora*) 種、E P N、エスフェンバレート、エチオフェンカルブ、エチプロール、エチオン、エトプロホス、エトフェンプロックス、エトキサゾール、エトリムホス、ファムフル、フェナミホス、フェナザキン、酸化フェンブタスズ、フェンフルスリン、フェニトロチオン、フェノブカルブ、フェノチオカルブ、フェノキサクリム (*fenoxacrim*)、フェノキシカルブ、フェンプロパトリン、フェンピラド、フェンピリトリン、フェンピロキシメート、フェンスルホチオン、フェンチオン、フェントリファニル (*fentrifanil*)、フェンバレート、フィプロニル、フロニカミド、フルアクリピリム、フルアズロン、フルベンジミン 50

、フルブロシスリナート (f l u b r o c y t h r i n a t e) 、フルシクロクスロン、フルシトリネート、フルフェネリム、フルフェノクスロン、フルフェンプロックス、フルメトリン、フルピラゾホス、フルテンジン (f l u t e n z i n) (フルフェンジン (f l u f e n z i n e)) 、フルバリネート、ホノホス、ホルメタネート、ホルモチオン、ホスメチラン (f o s m e t h i l a n) 、ホスチアゼート、フブフェンプロックス (f u b f e n p r o x) (フルプロキシフェン) (f l u p r o x y f e n)) 、フラチオカルブ (f u r a t h i o c a r b) 、ガンマ - H C H 、ゴッシープルレ (g o s s y p l u r e) 、グランドルレ (g r a n d l u r e) 、グラニユローシスウイルス、ハルフエンプロックス、ハロフェノジド (h a l o f e n o z i d e) 、H C H 、H C N - 8 0 1 、ヘプテノホス、フキサフルムロン、ヘキシチアゾクス、ヒドラメチルノン (h y d r a m e t h y l n o n e) 、ハイドロブレン、I K A - 2 0 0 2 、イミダクロブリド、イミプロトリン、インドキサカルブ、ヨードフェノホス、イプロベンホス、イサゾホス、イソフェンホス、イソプロカルブ、イソキサチオン、イベルメクチン、ジャポニルレ (j a p o n i l u r e) 、カデトリン、核多角体病ウイルス、キノブレン、ラムダ - シハロトリン、リンデン、ルフェヌロン、マラチオン、メカルバム、メスルフェンホス、メタアルデヒド、メタムナトリウム、メタクリホス、メタミドホス、メタリジウム アニソプリエ、メタリジウム フラボビリド (M e t a r a h i z i u m f l a v o v i r i d e) 、メチダチオン、メチオカルブ、メトミル、メトブレン、メトキシクロール、メトキシフェノジド、メトルカルブ、メトキサジアゾン、メビンホス、ミルベメクチン、ミルベマイシン、M K I - 2 4 5 、M O N - 4 5 7 0 0 、モノクロトホス、モキシデクチン、M T I - 8 0 0 、ナレド、N C - 1 0 4 、N C - 1 7 0 、N C - 1 8 4 、N C - 1 9 4 、N C - 1 9 6 、ニクロサミド、ニコチン、ニテンピラム、ニチアジン、N N I - 0 0 0 1 、N N I - 0 1 0 1 、N N I - 0 2 5 0 、N N I - 9 7 6 8 、ノバルロン、ノビフルムロン、O K - 5 1 0 1 、O K - 5 2 0 1 、O K - 9 6 0 1 、O K - 9 6 0 2 、O K - 9 7 0 1 、O K - 9 8 0 2 、オメトエート、オキサミル、オキシデメトンメチル、ペキロマイセス フモソロセウス (P a e c i l o m y c e s f u m o s o r o s e u s) 、パラチオンメチル、パラチオン (-エチル) 、ペルメトリン (シス - 、トランス -) 、石油、P H - 6 0 4 5 、フェノトリリン (1 R - t r a n s 異性体) 、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスマット、ホスファミドン、ホスホカルブ (p h o s p h o c a r b) 、ホキシム、ピペロニルブトキシド、ピリミカルブ、ピリミホスメチル、ピリミホスエチル、ブレトリン、プロフェノホス、プロメカルブ、プロパホス、プロパルギット、プロペタンホス、プロポキスル、プロチオホス、プロトエート、プロトリフェンビュート (p r o t r i f e n b u t e) 、ピメトロジン、ピラクロホス、ピレスメトリン (p y r e s m e t h r i n) 、ピレトラム、ピリダベン、ピリダリル、ピリダフェンチオン、ピリダチオン (p y r i d a t h i o n) 、ピリミジフェン、ピリプロキシフェン、キナルホス、レスメトリン、R H - 5 8 4 9 、リバビリン、R U - 1 2 4 5 7 、R U - 1 5 5 2 5 、S - 4 2 1 、S - 1 8 3 3 、サリチオン、セブホス (s e b u f o s) 、S I - 0 0 0 9 、シラフルオフェン、スピノサド、スピロディクロフェン、スピロメシフェン、スルフルラミド (s u l p h u r a m i d) 、スルホテップ、スルプロホス、S Z I - 1 2 1 、タウ - フルバリネート、テブフェノジド、テブフェンピラド、テブピリムホス、テフルベンズロン、テフルトリン、テメホス、テミビンホス、ターバム、テルブホス、テトラクロルビンホス、テトラジホン、テトラメトリン、テトラメトリン (1 R - 異性体) 、テトラサル、シータ - シペルメトリン、チアクロブリド、チアメトキサム、チアプロニル (t h i a p r o n i l) 、チアトリホス (t h i a t r i p h o s) 、シュウ酸水素チオシクラム、チオジカルブ、チオファノックス、チオメトン、チオサルタップ - ナトリウム (t h i o s u l t a p - s o d i u m) 、チューリンギエンシン (t h u r i n g i e n s i n) 、トルフェンピラド、トラロシトリリン (t r a l o c y t h r i n) 、トラロメトリン、トランスクルスリン、トリアラセン (t r i a r a t h e n e) 、トリアザメート (t r i a z a m a t e) 、トリアゾホス、トリアズロン (t r i a z u r o n) 、トリクロフェニジン (t r i c h l o p h e n i d i n e) 、トリクロルホン、トリフルムロン、ト 10
20
30
40
50

リメタカルブ、バミドチオン、バニリプロール (vaniliprole)、ベルブチン (verbutin)、バーティシリウム レカニ (Verticillium lecanii)、WL-108477、WL-40027、YI-5201、YI-5301、YI-5302、XMC、キシリルカルブ、ZA-3274、ゼータ-シペルメトリン、ゾラプロホス (zolaprofoss)、ZXI-8901、化合物3-メチルフェニル-プロピルカルバメート (ツマサイドZ))、化合物3-(5-クロロ-3-ピリジニル)-8-(2,2,2-トリフルオロエチル)-8-アザビシクロ[3.2.1]-オクタン-3-カルボニトリル (CAS-Reg. No. 185982-80-3) 及び対応する3-エンド-異性体 (CAS-Reg. No. 185984-60-5) (国際公開第96/37494号、同98/25923号参照) 並びに殺虫剤として有効な植物抽出物、線虫、真菌又はウイルスを含有する調製物。

【0149】

除草剤などの他の公知活性化合物との混合物、又は肥料及び成長調節物質、毒性緩和剤及び/又は信号化学物質との混合物も可能である。

【0150】

さらに、本発明による式(I)の化合物は、きわめて良好な抗真菌活性も有する。本発明による一般式(I)の化合物は、特に、皮膚糸状菌及び酵母、カビ及び二相性真菌(例えば、カンジダ アルビカンス (Candida albicans)、カンジダ グラブラー (Candida glabrata)などのカンジダ種に対して)並びにエピデルモフィトン フロッコーズム (Epidermophyton floccosum)、アスペルギルス ニガー (Aspergillus niger)、アスペルギルス フミガーツス (Aspergillus fumigatus)などのアスペルギルス種、トリコフィトン メンタグロフィテス (Trichophyton mentagrophytes)などのトリコフィトン種、マイクロスボロン カニス (Microsporon canis)、マイクロスボロン オードアン (Microsporon audouinii)などのマイクロスボロン種に対して、きわめて広い抗真菌活性スペクトルを有する。これらの真菌のリストは、網羅され得る真菌スペクトルを決して限定するものではなく、単なる例示にすぎない。

【0151】

本活性物質は、そのまま、それらの製剤の形又はすぐに使用できる溶液、懸濁液、水和剤、ペースト、可溶性粉末、粉剤、顆粒などのそれらから調製される使用剤形 (use form) として使用することができる。適用は、通常の方法、例えば、かん水、噴霧、微粒化、散布、散布、発泡、拡散などによって実施される。また、超低体積法 (ultra-low volume method) によって活性化合物を適用し、又は活性化合物調製物若しくは活性化合物自体を土壤中に注入することもできる。植物の種子を処理することもできる。

【0152】

本発明の活性化合物を殺真菌剤として使用するときには、適用の種類に応じて、散布量は比較的広範囲に変わり得る。植物の各部分を処理する場合には、本活性化合物の散布量は、一般に0.1から10,000g/ha、好ましくは10から1,000g/haである。種子粉衣の場合には、本活性物質の散布量は、一般に0.001から50g/kg種子、好ましくは0.01から10g/kg種子である。土壤を処理する場合には、本活性化合物の散布量は、一般に0.1から10,000g/ha、好ましくは1から5,000g/haである。

【0153】

上述したように、全植物及びそれらの部分を本発明によって処理することができる。好ましい実施形態においては、野草種及び植物栽培品種又は異種交配、原形質体融合などの従来の生物学的育種によって得られたもの並びにそれらの部分が処理される。さらに好ましい実施形態においては、従来の方法と妥当な場合には組み合わせられた遺伝子工学によって得られるトランスジェニック植物及び植物栽培品種(遺伝子改変生物)並びにそれら

10

20

30

40

50

の部分が処理される。「部分」又は「植物の部分」又は「植物部分」という用語は上で説明された。

【0154】

特に好ましくは、それぞれ市販され又は使用されている植物栽培品種の植物が本発明に従って処理される。植物栽培品種とは、従来の品種改良、突然変異誘発又は組換えDNA技術によって得られた新しい諸特性（「形質」）を有する植物を意味すると理解される。これらは、植物栽培品種、変種、生物型又は遺伝子型とすることができます。

【0155】

本発明による処理は、植物種又は植物栽培品種、それらの場所及び栽培条件（土壤、天候、生育期、飼料）に応じて超加法的（「相乗」）効果をもたらすことができる。したがって、例えば、実際に予想された効果を上回って、散布量の減少及び／又は活性スペクトルの拡大及び／又は本発明に従って使用することができる物質及び組成物の活性の増加、植物のより良好な成長、高温又は低温に対する耐性の増加、渴水、含水量又は土壤塩分に対する耐性の増加、開花能の向上、採取の簡易化、成熟の加速、収穫高の増大、収穫産物の品質の向上及び／又は栄養価の増加、収穫産物の貯蔵安定性及び／又は加工性の向上が可能である。

【0156】

本発明によって好ましく処理されるトランスジェニック植物又は植物栽培品種（すなわち、遺伝子工学によって得られるもの）としては、遺伝子改変において、これらの植物に特に有利で有用な諸特性（「形質」）を付与する遺伝物質が与えられた全ての植物が挙げられる。かかる諸特性の例は、植物のより良好な成長、高温又は低温に対する耐性の増加、渴水、含水量又は土壤塩分に対する耐性の増加、開花能の向上、採取の簡易化、成熟の加速、収穫高の増大、収穫産物の品質の向上及び／又は栄養価の増加、収穫産物の貯蔵安定性及び／又は加工性の向上である。かかる諸特性のさらに特に強調される例は、昆虫、ダニ、植物病原性真菌、細菌及び／又はウイルスなどの有害動物や有害微生物に対する植物の防御力の向上であり、除草活性を有するある種の化合物に対する植物の耐性でもある。トランスジェニック植物の例としては、穀物（コムギ、イネ）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、ワタ、タバコ、アブラナ、（リンゴ、セイヨウナシ、かんきつ類の果物、ブドウがなる）果実植物などの重要な作物を挙げることができ、特に、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、ワタ、タバコ及びアブラナである。重視される形質は、特に、植物中で形成される毒素、特に、バチルス チューリングンシス由来の遺伝物質によって（例えば、遺伝子CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb及びCryIF並びにそれらの組み合わせによって）植物中で形成される毒素による昆虫、クモ類、線虫及びナメクジ類及びカタツムリに対する植物の防御力の増大である（以下、「Bt植物」と称する）。同じく特に重視される形質は、全身獲得抵抗性（SAR）、システィミン、フィトアレキシン、エリシター及び耐性遺伝子並びに対応して発現されたタンパク質及び毒素による真菌、細菌及びウイルスに対する植物の防御力の増大である。さらに特に重視される形質は、除草活性を有するある種の化合物、例えば、イミダゾリノン、スルホニル尿素、グリホサート又はホスフィノトリシンに対する植物の耐性の増大である（例えば、「PAT」遺伝子）。目的とする所望の形質を付与する遺伝子は、トランスジェニック植物中で相互に組み合わせて存在することもできる。「Bt植物」の例としては、YIELD GARD（登録商標）（例えばトウモロコシ、ワタ、ダイズ）、Knock Out（登録商標）（例えばトウモロコシ）、StarLink（登録商標）（例えばトウモロコシ）、Bollgard（登録商標）（ワタ）、Nucotin（登録商標）（ワタ）及びNewLeaf（登録商標）（ジャガイモ）の商品名で販売されているトウモロコシの変種、ワタの変種、ダイズの変種及びジャガイモの変種を挙げることができる。除草剤耐性植物としては、Roundup Ready（登録商標）（グリホサートに対する耐性、例えばトウモロコシ、ワタ、ダイズ）、Liberty Link（登録商標）（ホスフィノトリシンに対する耐性、例えばアブラナ）、IMI（登録商標）（イミダゾリノンに対する耐性、例えばトウモロコシ、ワタ、ダイズ）である。

10

20

30

40

50

リノン類に対する耐性) 及び S T S (登録商標) (スルホニル尿素に対する耐性、例えばトウモロコシ) の商品名で販売されているトウモロコシの変種、ワタの変種及びダイズの変種を挙げることができる。除草剤抵抗性植物(除草剤耐性を与えるために従来の方式で品種改良された植物)としては、Clearfield (登録商標) (例えばトウモロコシ) の商品名で販売されている変種が挙げられる。これらの記述は、これらの遺伝的形質若しくは開発中の遺伝的形質を有する植物栽培品種、又は将来開発され及び/又は上市される植物栽培品種についても当てはまる。

【0157】

列挙された前記植物は、本発明による一般式(I)の化合物又は活性化合物混合物を用いて特に有利な方法で本発明に従って処理することができる。活性化合物又は混合物に対して上述された好ましい範囲は、これらの植物の処理についても当てはまる。本明細書に明記されている化合物又は混合物による植物の処理は特に重要である。

10

【0158】

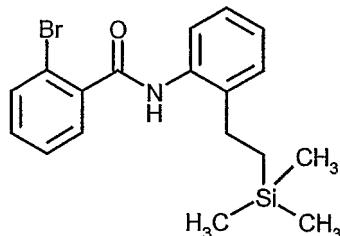
本発明の活性化合物の調製及び使用は以下の実施例によって説明される。

調製例

(実施例1)

【0159】

【化52】



20

【0160】

2-(2-(2-トリメチルシリルエチル)フェニルアミン 425 mg (2.2 mmol) 及び 2-ブロモ-塩化ベンゾイル 438 mg (2.0 mmol) をアセトニトリル 20 ml に溶解し、炭酸カリウム 332 mg (2.4 mmol) を添加した。反応混合物を室温で 18 時間攪拌し、次いで水 20 ml を添加し、混合物を酢酸エチルで抽出し、抽出物を硫酸ナトリウムで脱水した。溶媒を除去し、シリカゲル 60 (移動相: 塩化メチレン) 上のカラムクロマトグラフィー精製にかけて、2-ブロモ-N-[2-(2-トリメチルシリルエチル)フェニル]ベンズアミド 405 mg (理論値の 54%) を得た [log P (pH 2.3) = 4.32]。

30

【0161】

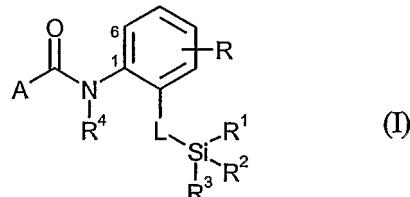
下記表1に記載された式(I)の化合物も、実施例1と同様に、本発明の調製プロセス(a)及び(b)の一般的記述中の指示に従って得られた。

表1

【0162】

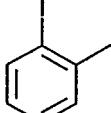
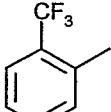
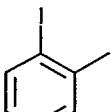
【化53】

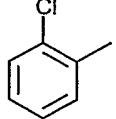
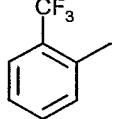
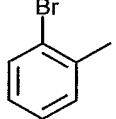
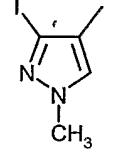
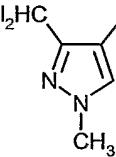
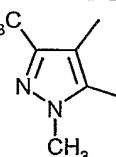
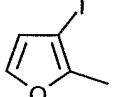
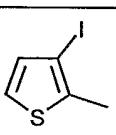
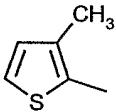
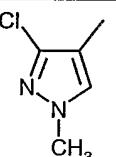
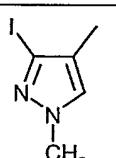
40

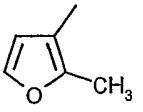
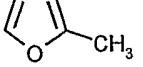
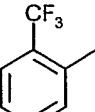
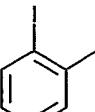
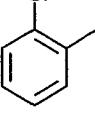
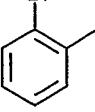
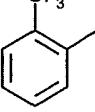
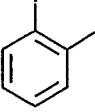
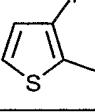
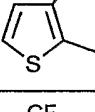
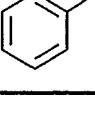


【0163】

【表 1】

Bsp.	R	L	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	logP
2	H	[*] -CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.67
3	H	[*] -CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.63
4	H	[*] -CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.40

Bsp.	R	L	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	logP
5	H	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.29
6	H	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.37
7	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.58
8	H	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3.68
9	H	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3.95
10	H	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.19
11	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.73
12	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		5.05
13	H	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.43
14	H	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3.89
15	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3.94

Bsp.	R	L	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	logP
16	H	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.03
17	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.33
18	H	*-CH≡CH#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.78
19	H	*-CH≡CH#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.97
20	H	*-CH≡CH#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.96
21	H	*-CH≡CH#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.93
22	4-F	*-CH(CH ₃)-CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.61
23	4-F	*-CH(CH ₃)-CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.64
24	H	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.85
25	4-F	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.79
26	4-F	*-CH ₂ -CH ₂ #	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.39

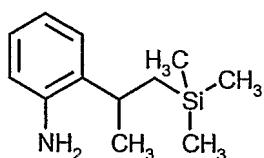
アステリスク(*)の付いた結合はアニリン基に結合し、ハッシュ(#)の付いた結合はケイ素置換基に結合する。

【0164】

式(I I I)の出発材料の調製
(実施例(I I I-1))

【0165】

【化54】



【0166】

アニリン 17.7 g (0.19 mol)、アリルトリメチルシラン 50 g (0.44 mol)、塩化アルミニウム 1.5 g (0.01 mol) 及びアルミニウム粉末 0.5 g (0.02 mol) を混合し、オートクレーブ中で 255 °C で 10 時間攪拌した。室温に冷却後、最初にトルエン 100 ml、次いで 40% NaOH 水溶液 40 ml 及び水 100 ml を添加し、混合物を 35 °C で 15 分間攪拌した。冷却後、混合物をトルエンで抽出し、抽出物を水で洗浄し、炭酸カリウムで脱水し、溶媒を減圧除去した。蒸留 (55 °C から 60 °C, 0.08 mbar (8 Pa)) して、2-(1-メチル-2-トリメチルシリルエチル)フェニルアミン 1.4 g を得た [log P (pH 2.3) = 3.05]。 10

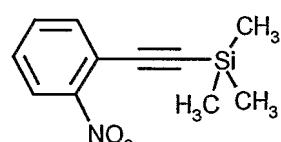
【0167】

(実施例 (III-2))

段階 1

【0168】

【化55】



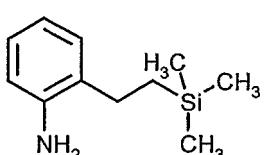
【0169】

オルソ-ブロモニトロベンゼン 4 g (20 mmol)、塩化ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム (II) 842 mg (1.2 mmol) 及びヨウ化銅 (I) 230 mg (1.2 mmol) をアルゴン下でトリエチルアミン 40 ml に最初に仕込んだ。次いで、トリメチルシリルアセチレン 2.95 g (30 mmol) を室温で 10 分間滴下し、混合物を室温で 2 日間攪拌した。反応混合物を水 50 ml に注ぎ、それぞれジエチルエーテル 50 ml で 3 回抽出し、抽出物を硫酸ナトリウムで脱水し、濃縮した。シリカゲル 60 (移動相: シクロヘキサン / �酢酸エチル 3 : 1) 上でカラムクロマトグラフィー精製して、トリメチル-(2-ニトロフェニル-エチニル)シラン 4.2 g (理論値の 96%) を得た [log P (pH 2.3) = 4.12]。 30

段階 2

【0170】

【化56】



【0171】

トリメチル-(2-ニトロフェニルエチニル)シラン 10.9 g (50 mmol) をメタノール 200 ml に溶解し、炭素担持パラジウム (5%) 0.5 g を添加した。次いで、混合物をオートクレーブ中で 4 bar (0.4 MPa) で 12 時間水素化した。溶媒を除去し、シリカゲル 60 (移動相: 塩化メチレン) 上のカラムクロマトグラフィー精製にかけて、2-(2-トリメチルシリルエチル)フェニルアミン 4.1 g を得た [log P (pH 2.3) = 4.05]。 50

(pH 2.3) = 2.58]。

【0172】

示したlog P値は、E E C Directive 79/831 Annex V. A8に従って逆相カラム(C18)を用いたHPLC(高速液体クロマトグラフィー)によって測定された。温度: 43°。

【0173】

酸性範囲(pH 2.3)における測定用移動相: 0.1%リン酸水溶液、アセトニトリル; 10%アセトニトリルから90%アセトニトリルの線形勾配。

【0174】

較正は、log P値(2個の連続したアルカノン間を線形補間した保持時間によるlog P値の測定)が既知の非分枝アルカン-2-オン(3から16炭素原子)を用いて実施された。

【0175】

max値は、クロマトグラフィーのシグナルの最大値において200nmから400nmのUVスペクトルを用いて測定された。

使用例

(実施例A)

ベンチュリア試験(リンゴ) / 防御性

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

20

乳化剤: アルキルアリールポリグリコールエーテル 1 重量部

活性化合物の適切な調製物を製造するために、活性化合物 1 重量部を溶媒及び乳化剤の上記量と混合し、濃縮物を所望の濃度に水で希釈する。

【0176】

防御活性を試験するために、若い植物に活性化合物調製物を上記散布量で噴霧する。噴霧コーティングを乾燥させた後、リンゴ病原体ベンチュリア イナエクアリスの分生子水懸濁液を植物に接種し、次いで約20° 及び 100%相対大気湿度のインキュベーション室に1日放置する。

【0177】

次いで、植物を約21° 及び約90%相対大気湿度の温室に置く。

30

【0178】

評価は、接種から10日後に実施される。0%は対照の効力に相当する効力を意味し、100%の効力は感染が観測されないことを意味する。

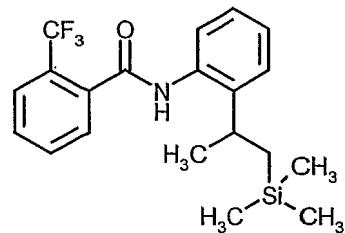
表A

ベンチュリア試験(リンゴ) / 防御性

【0179】

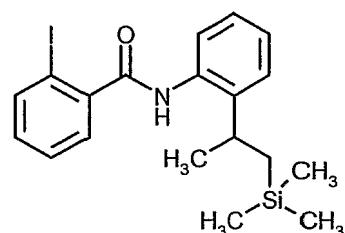
【表2】

本発明の活性化合物	活性化合物散布量 (g/ha)	効力(%)
-----------	--------------------	-------

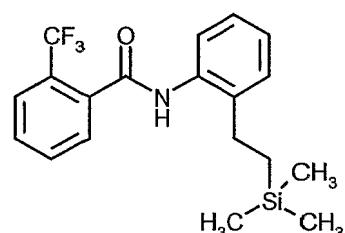


100 99

10

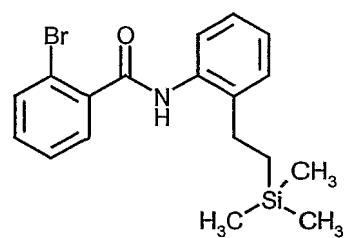


100 100



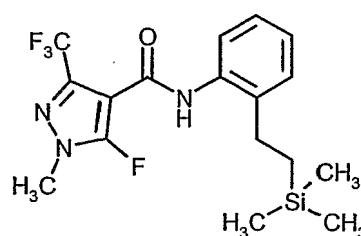
100 84

20

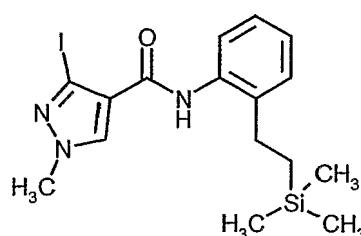


100 87

30



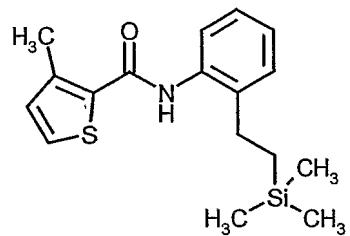
100 100



100 100

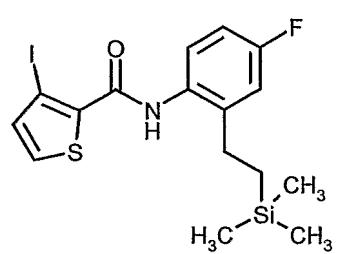
40

本発明の活性化合物	活性化合物散布量 (g/ha)	効力(%)
-----------	--------------------	-------



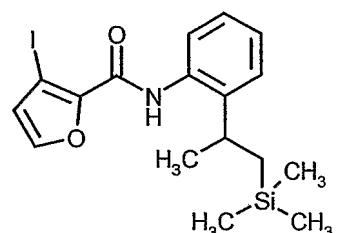
100 100

10



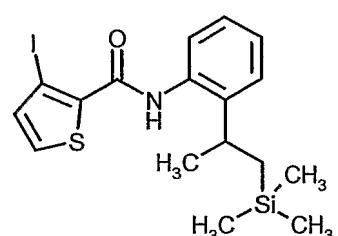
100 100

10



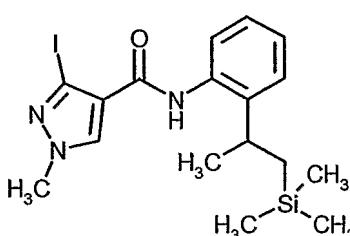
100 100

20



100 100

30



100 99

40

【0180】

(実施例B)

スファエロセカ試験(キュウリ) / 防御性

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

活性化合物の適切な調製物を製造するために、活性化合物1重量部を溶媒及び乳化剤の上記量と混合し、濃縮物を所望の濃度に水で希釈する。

【0181】

防御活性を試験するために、若いキュウリに活性化合物調製物を上記散布量で噴霧する。処理から1日後、植物にスファエロセカ フリギニアの胞子懸濁液を接種する。次いで、植物を70%相対大気湿度及び約23℃の温室に置く。

【0182】

50

評価は、接種から 7 日後に実施される。0 % は対照の効力に相当する効力を意味し、100 % の効力は感染が観測されないことを意味する。

表 B

スファエロセカ試験（キュウリ）／防御性

【0183】

【表 3】

本発明の活性化合物	活性化合物散布量 (g/ha)	効力(%)	
	750	100	10
	750	100	20
	750	100	30

【0184】

(実施例 C)

ブクキニア試験（コムギ）／防御性

溶媒：N, N -ジメチルアセトアミド 50 重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル 1 重量部

活性化合物の適切な調製物を製造するために、活性化合物 1 重量部を溶媒及び乳化剤の示した量と混合し、濃縮物を所望の濃度に水で希釈する。

【0185】

防御活性を試験するために、若い植物に活性化合物調製物を上記散布量で噴霧する。噴霧コーティングを乾燥させた後、ブクキニア レコンジタの分生子懸濁液を植物に噴霧する。植物を 20 及び 100 % 相対大気湿度のインキュベーション室に 48 時間放置する。

【0186】

次いで、植物を約 20 及び相対大気湿度 80 % の温室において、サビ病のいぼ (rust pustule) の発生を促進する。

【0187】

評価は、接種から 10 日後に実施される。0 % は対照の効力に相当する効力を意味し、100 % の効力は感染が観測されないことを意味する。

表 C

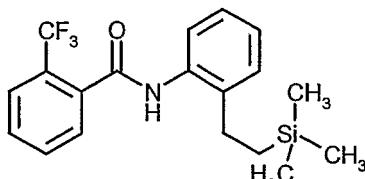
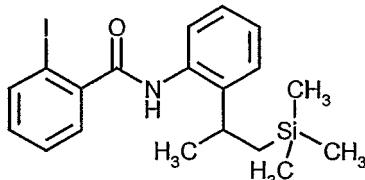
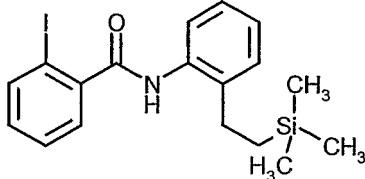
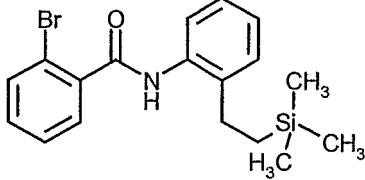
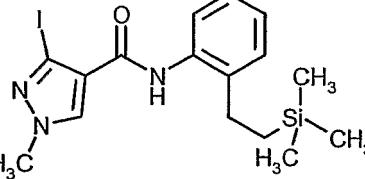
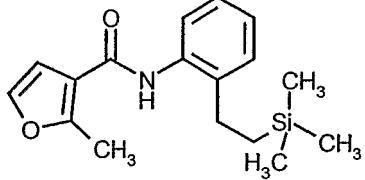
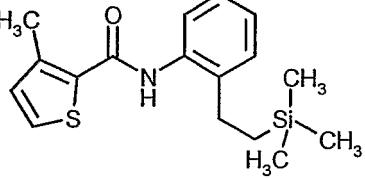
ブクキニア試験（コムギ）／防御性

40

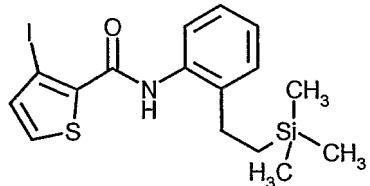
50

【0188】

【表4】

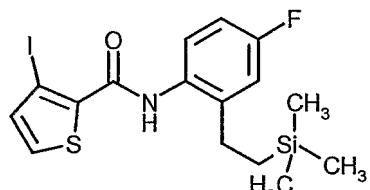
本発明の活性化合物	活性化合物散布量 (g/ha)	効力(%)
	500	93
		10
	500	100
		100
	500	100
		20
	500	100
		100
	500	100
		30
	500	100
		40
	500	100

本発明の活性化合物	活性化合物散布量 (g/ha)	効力(%)
-----------	--------------------	-------



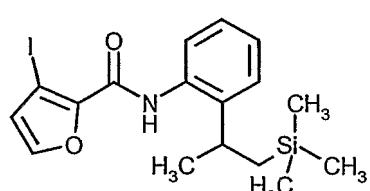
500

100



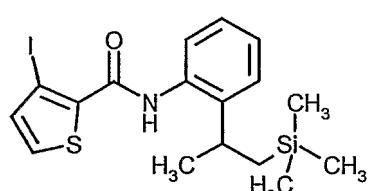
500

100



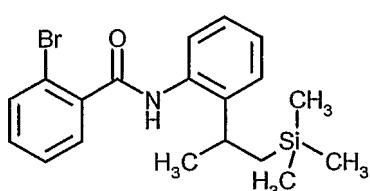
500

100



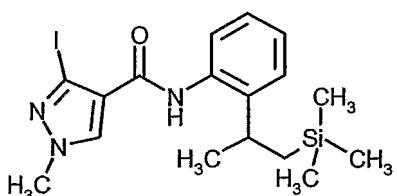
500

100



500

100



500

100

10

20

30

フロントページの続き

(51)Int.Cl.

F I

A 0 1 P 3/00
 C 0 7 B 61/00 3 0 0

(74)代理人 100124855

弁理士 坪倉 道明

(72)発明者 ダンケル, ラルフ

フランス国、6 9 0 0 1 · リヨン、リュ・ピエール・ドゥ・ポン・9 / 1 1

(72)発明者 エルベ, ハンス - ルートビヒ

ドイツ国、4 2 3 2 9 · ブツパートール、ダスネットケル · 5 9

(72)発明者 アルトマン, ブノワ

ドイツ国、4 0 7 6 4 · ランゲンフエルト、ファーバーシュトラーセ · 1

(72)発明者 クラウスナー, アレクサンダー

ドイツ国、5 0 2 5 9 · プルハイム、シフシスウエヒ · 1 8

(72)発明者 グロイル, イエルク・ニコ

ドイツ国、4 2 7 9 9 · ライヒリンゲン、アム・ザントベルク · 3 0 · ア-

(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、オーバラー・マルケンベーカー · 8 5

(72)発明者 ダーメン, ペーター

ドイツ国、4 1 4 7 0 · ノイス、アルテブリュツカーシュトラーセ · 6 1

(72)発明者 クツク, カール - ハインツ

ドイツ国、4 0 7 6 4 · ランゲンフエルト、パストア - レー - シュトラーセ · 3 0 · ア-

審査官 小久保 敦規

(56)参考文献 国際公開第0 3 / 0 8 0 6 2 8 (WO, A 1)

特開平0 6 - 1 9 9 8 0 3 (JP, A)

特表2 0 0 0 - 5 1 6 9 1 7 (JP, A)

特開2 0 0 3 - 0 4 8 8 7 8 (JP, A)

特開2 0 0 1 - 0 7 2 5 1 0 (JP, A)

Tetrahedron, Vol.46, No.4, p.1379-1384 (1990).

Chemical & Pharmaceutical Bulletin, Vol.35, No.5, p.1823-1828 (1987).

Chemische Berichte, Vol.116, No.10, p.3375-3405 (1983).

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07F 7/00-7/30

A01N 1/00-65/38

A01P 1/00-23/00

CAplus(STN)

REGISTRY(STN)