

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第4825395号
(P4825395)

(45) 発行日 平成23年11月30日(2011.11.30)

(24) 登録日 平成23年9月16日(2011.9.16)

(51) Int.Cl.

F 1

C07C 251/48	(2006.01)	C 07 C 251/48	C S P
AO1N 37/22	(2006.01)	AO1N 37/22	1 O 1
AO1N 43/08	(2006.01)	AO1N 43/08	B
AO1N 43/10	(2006.01)	AO1N 43/10	C
AO1N 43/32	(2006.01)	AO1N 43/32	

請求項の数 14 (全 114 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2002-514103 (P2002-514103)
(86) (22) 出願日	平成13年7月11日 (2001.7.11)
(65) 公表番号	特表2004-504383 (P2004-504383A)
(43) 公表日	平成16年2月12日 (2004.2.12)
(86) 國際出願番号	PCT/EP2001/007981
(87) 國際公開番号	W02002/008197
(87) 國際公開日	平成14年1月31日 (2002.1.31)
審査請求日	平成20年7月9日 (2008.7.9)
(31) 優先権主張番号	100 35 857.8
(32) 優先日	平成12年7月24日 (2000.7.24)
(33) 優先権主張国	ドイツ(DE)
(31) 優先権主張番号	101 22 447.8
(32) 優先日	平成13年5月9日 (2001.5.9)
(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	110000741 特許業務法人小田島特許事務所
(72) 発明者	エルベ、ハンスルートビヒ ドイツ42329ブツベルタール・ダスネ ツケル59
(72) 発明者	リーケ、ハイコ ドイツ40764ランゲンフエルト・グー トルンシュトラーセ4

最終頁に続く

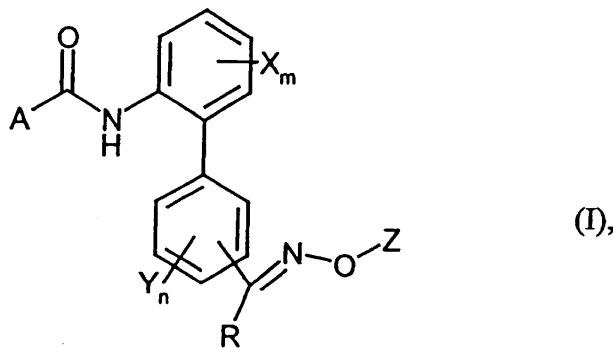
(54) 【発明の名称】 ピフェニルカルボキシアミド類

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(I)

【化 1】



10

[式中、

Rは水素、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキルを示すか、あるいは1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₆-ハロゲノアルキルを示し、Zは水素、C₁-C₆-アルキルを示すか、あるいは1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₆-ハロゲノアルキルを示し、

X及びYは互いに独立してそれぞれハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、カルボキシ

20

ル、C₁ - C₈ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₆ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₈ - アルコキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₆ - ハロゲノアルコキシ、C₁ - C₈ - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₆ - ハロゲノアルキルチオ、C₂ - C₈ - アルケニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₂ - C₈ - ハロゲノアルケニルオキシ、C₃ - C₈ - アルキニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₃ - C₈ - ハロゲノアルキニルオキシ、C₃ - C₈ - シクロアルキル、C₁ - C₈ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₈ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₈ - アルキルスルホニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₈ - ハロゲノアルキルスルフィニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₈ - ハロゲノアルキルスルホニル又はC₁ - C₆ - アルコキシミノ - C₁ - C₆ - アルキルを示し、

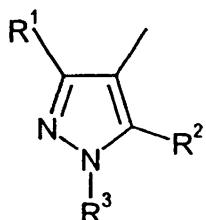
10

mは0 ~ 3 の整数を示し、ここでmが2 又は3 を示す場合、Xは同一もしくは異なる基を示し、

nは0 ~ 4 の整数を示し、ここでnが2、3 又は4 を示す場合、Yは同一もしくは異なる基を示し、

Aは式

【化2】



20

の基を示し、ここで

) R¹は水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、C₁ - C₄ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルチオ、アミノカルボニル又はアミノカルボニル - C₁ - C₄ - アルキルを示し、

R²は水素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ又はC₁ - C₄ - アルキルチオを示し、

30

R³は水素、C₁ - C₄ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキル、ヒドロキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₄ - アルキルチオ - C₁ - C₄ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルチオ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル又はフェニルを示すか、

あるいは

) R¹は水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、C₂ - C₄ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルチオ、アミノカルボニル又はアミノカルボニル - C₁ - C₄ - アルキルを示し、

40

R²はフッ素を示し、

R³は水素、C₁ - C₄ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキル、ヒドロキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₄ - アルキルチオ - C₁ - C₄ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルチオ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル又はフェニルを示すか、

50

あるいは

) R¹は水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、C₁ - C₄ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルチオ、アミノカルボニル又はアミノカルボニル - C₁ - C₄ - アルキルを示し、

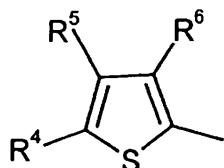
R²はフッ素を示し、

R³は水素、C₂ - C₄ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキル、ヒドロキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₄ - アルキルチオ - C₁ - C₄ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルチオ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル又はフェニルを示すか、

あるいは

A は式

【化 3】



10

20

の基を示し、ここで

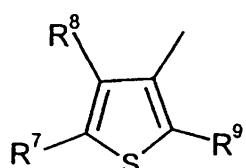
R⁴ 及び R⁵ は互いに独立してそれぞれ水素、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル又は1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルを示し、

R⁶ はハロゲン、シアノ又はC₁ - C₄ - アルキルもしくは1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルコキシを示すか、

あるいは

A は式

【化 4】



30

の基を示し、ここで

R⁷ 及び R⁸ は互いに独立してそれぞれ水素、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル又は1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルを示し、

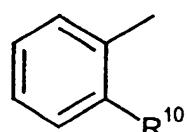
R⁹ は水素、C₁ - C₄ - アルキルを示すか、又はハロゲンを示すか、

あるいは

A は式

【化 5】

40



の基を示し、ここで

R¹⁰ は水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、C₁ - C₆ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄

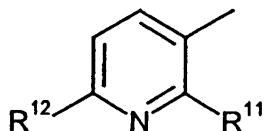
50

- ハロゲノアルコキシを示すか、又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₄ - ハロゲノアルキルチオを示すか、

あるいは

A は式

【化 6】



10

の基を示し、ここで

R¹¹はハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₄ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₄ - ハロゲノアルキルチオを示すか、又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₄ - ハロゲノアルコキシを示し、

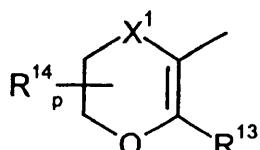
R¹²は水素、ハロゲン、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₄ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₄ - ハロゲノアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルスルフィニルを示すか、又は C₁ - C₄ - アルキルスルホニルを示すか、

あるいは

20

A は式

【化 7】



の基を示し、ここで

R¹³は C₁ - C₄ - アルキルを示すか、又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₄ - ハロゲノアルキルを示し、

30

R¹⁴は C₁ - C₄ - アルキルを示し、

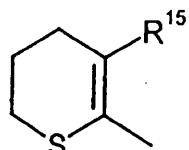
X¹は硫黄原子を示すか、SO、SO₂もしくは CH₂を示し、

p は 0、1 又は 2 を示すか、

あるいは

A は式

【化 8】



40

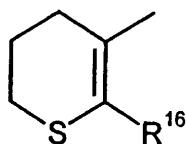
の基を示し、ここで

R¹⁵は C₁ - C₄ - アルキルを示すか、又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₄ - ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

A は式

【化9】



の基を示し、ここで

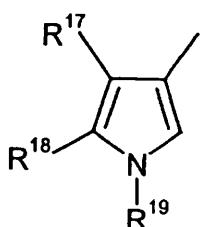
R¹⁶はC₁-C₄-アルキルを示すか、又は1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aは式

10

【化10】



の基を示し、ここで

20

R¹⁷はハロゲン、シアノ、C₁-C₄-アルキルを示すか、又は1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルキルを示し、

R¹⁸は水素、ハロゲン、C₁-C₄-アルキルを示すか、又は1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルキルを示し、

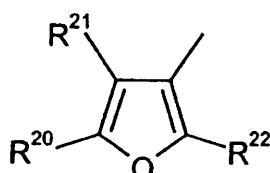
R¹⁹は水素、シアノ、C₁-C₄-アルキル、1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、ヒドロキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルスルホニル、ジ(C₁-C₄-アルキル)-アミノスルホニル、C₁-C₆-アルキルカルボニルを示すか、又は場合により置換ができるフェニルスルホニル又はベンゾイルを示すか、

あるいは

30

Aは式

【化11】



の基を示し、ここで

40

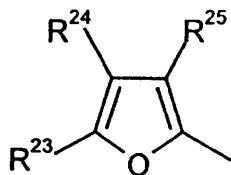
R²⁰及びR²¹は互いに独立してそれぞれ水素、ハロゲン、アミノ、C₁-C₄-アルキルを示すか、又は1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルキルを示し、

R²²は水素、ハロゲン、C₁-C₄-アルキルを示すか、又は1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aは式

【化12】



の基を示し、ここで

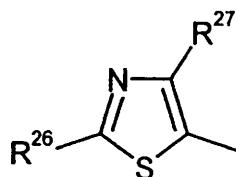
R²³及びR²⁴は互いに独立してそれぞれ水素、ハロゲン、アミノ、ニトロ、C₁-C₄-アルキルを示すか、又は1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルキルを示し、

R²⁵は水素、ハロゲン、C₁-C₄-アルキルを示すか、又は1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aは式

【化13】



20

の基を示し、ここで

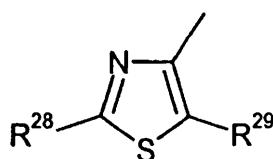
R²⁶は水素、ハロゲン、アミノ、C₁-C₄-アルキルアミノ、ジ-(C₁-C₄-アルキル)アミノ、シアノ、C₁-C₄-アルキルを示すか、又は1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルキルを示し、

R²⁷はハロゲン、C₁-C₄-アルキル又は1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aは式

【化14】



30

の基を示し、ここで

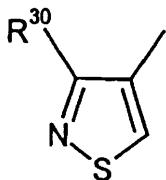
R²⁸は水素、ハロゲン、アミノ、C₁-C₄-アルキルアミノ、ジ-(C₁-C₄-アルキル)アミノ、シアノ、C₁-C₄-アルキルを示すか、又は1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルキルを示し、

R²⁹はハロゲン、C₁-C₄-アルキル又は1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aは式

【化15】



の基を示し、ここで

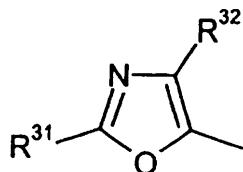
R³⁰はハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル又は1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルを示すか、

10

あるいは

Aは式

【化16】



の基を示し、ここで

20

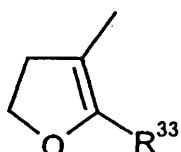
R³¹は水素又はC₁ - C₄ - アルキルを示し、

R³²はハロゲン又はC₁ - C₄ - アルキルを示すか、

あるいは

Aは式

【化17】



30

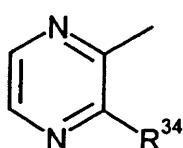
の基を示し、ここで

R³³はC₁ - C₄ - アルキル又は1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aは式

【化18】



40

の基を示し、ここで

R³⁴は水素、ハロゲンを示すか、又はC₁ - C₄ - アルキルを示す】

のビフェニルカルボキシアミド類。

【請求項2】

Rが水素、C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキルあるいは1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルを示し、

Zが水素、C₁ - C₄ - アルキルあるいは1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルを示し、

X及びYが互いに独立してそれぞれフッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、

50

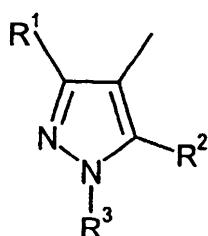
カルボキシル、C₁ - C₆ - アルキル、1 ~ 5 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有する C₁ - C₂ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、1 ~ 5 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有する C₁ - C₂ - ハロゲノアルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、1 ~ 5 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有する C₁ - C₂ - ハロゲノアルキルチオ、C₂ - C₆ - アルケニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₂ - C₆ - ハロゲノアルケニルオキシ、C₃ - C₆ - アルキニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₃ - C₆ - ハロゲノアルキニルオキシ、C₃ - C₇ - シクロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₆ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₆ - ハロゲノアルキルスルフィニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ - C₆ - ハロゲノアルキルスルホニルを示すか、又は C₁ - C₄ - アルコキシイミノ - C₁ - C₄ - アルキルを示し、
10

m が 0 ~ 3 の整数を示し、ここで m が 2 又は 3 を示す場合、X は同一もしくは異なる基を示し、

n が 0 ~ 4 の整数を示し、ここで n が 2、3 又は 4 を示す場合、Y は同一もしくは異なる基を示し、

A が式

【化 19】



10

20

の基を示し、ここで

) R¹ は水素、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、イソプロピル、1 ~ 5 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有する C₁ - C₂ - ハロゲノアルキル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、1 ~ 5 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有する C₁ - C₂ - ハロゲノアルコキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、アミノカルボニル、アミノカルボニルメチル又はアミノカルボニルエチルを示し、
30

R² は水素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ又はエチルチオを示し、

R³ は水素、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、1 ~ 5 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有する C₁ - C₂ - ハロゲノアルキル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル又はフェニルを示すか、あるいは

) R¹ は水素、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、エチル、イソプロピル、1 ~ 5 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有する C₁ - C₂ - ハロゲノアルキル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、1 ~ 5 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有する C₁ - C₂ - ハロゲノアルコキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、アミノカルボニル、アミノカルボニルメチル又はアミノカルボニルエチルを示し、
40

R² はフッ素を示し、

R³ は水素、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、1 ~ 5 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有する C₁ - C₂ - ハロゲノアルキル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル又はフェニルを示すか、あるいは

) R¹ は水素、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、イソプロピル、1 ~ 5 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有する C₁ - C₂ - ハロゲノアルキル、シ
50

クロプロピル、メトキシ、エトキシ、1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルコキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、アミノカルボニル、アミノカルボニルメチル又はアミノカルボニルエチルを示し、

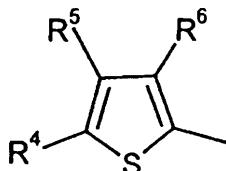
R²はフッ素を示し、

R³は水素、エチル、n-プロピル、イソプロピル、1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシリル又はフェニルを示すかあるいは

Aが式

【化20】

10



の基を示し、ここで

R⁴及びR⁵は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示し

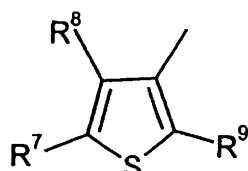
20

R⁶はフッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルコキシを示すか、

あるいは

Aが式

【化21】



30

の基を示し、ここで

R⁷及びR⁸は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示し

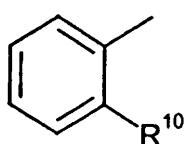
R⁹は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル又はエチルを示すか、

あるいは

Aが式

【化22】

40

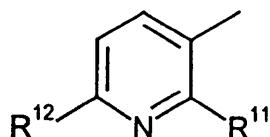


の基を示し、ここで

R¹⁰は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、シアノ、C₁-C₄-アルキル、1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキル、1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルコキシを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキ

50

ルチオを示すか、
あるいは
A が式
【化 2 3】

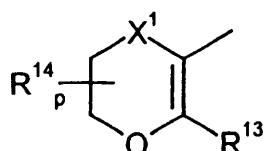


の基を示し、ここで

R¹¹はフッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、1 ~ 5 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有するC₁ - C₂ - ハロゲノアルキル、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を示すか、又は1 ~ 5 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有するC₁ - C₂ - ハロゲノアルコキシを示し、

R¹²は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、1 ~ 5 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有するC₁ - C₂ - ハロゲノアルキル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオを示すか、1 ~ 5 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有するC₁ - C₂ - ハロゲノアルコキシ、C₁ - C₂ - アルキルスルフィニル又はC₁ - C₂ - アルキルスルホニルを示すか、

あるいは
A が式
【化 2 4】



の基を示し、ここで

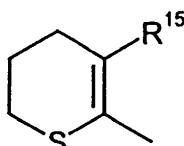
R¹³はメチル、エチルを示すか、又は1 ~ 5 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有するC₁ - C₂ - ハロゲノアルキルを示し、

R¹⁴はメチル又はエチルを示し、

X¹は硫黄原子を示すか、SO、SO₂もしくはCH₂を示し、

pは0、1又は2を示すか、

あるいは
A が式
【化 2 5】



の基を示し、ここで

R¹⁵はメチル、エチルを示すか、又は1 ~ 5 個のフッ素、塩素及び / 又は臭素原子を有するC₁ - C₂ - ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは
A が式

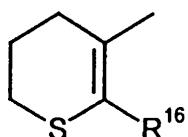
10

20

30

40

【化26】



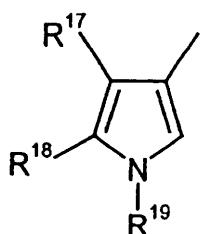
の基を示し、ここで

R¹⁶はメチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aが式

【化27】



の基を示し、ここで

R¹⁷はフッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、イソプロピルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示し、

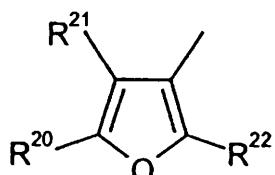
R¹⁸は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示し、

R¹⁹は水素、メチル、エチル、1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキル、C₁-C₂-アルコキシ-C₁-C₂-アルキル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、メチルスルホニル又はジメチルアミノスルホニルを示すか、

あるいは

Aが式

【化28】



の基を示し、ここで

R²⁰及びR²¹は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示し、

R²²は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aが式

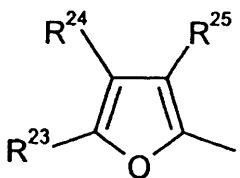
10

20

30

40

【化 2 9】



の基を示し、ここで

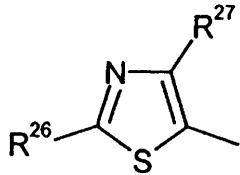
R²³及びR²⁴は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、ニトロ、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示し、

R²⁵は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aが式

【化 3 0】



10

20

の基を示し、ここで

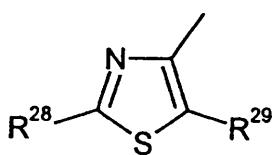
R²⁶は水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、C₁-C₄-アルキルアミノ、ジ-(C₁-C₄-アルキル)アミノ、シアノ、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示し、

R²⁷はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aが式

【化 3 1】



30

の基を示し、ここで

R²⁸は水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、C₁-C₄-アルキルアミノ、ジ-(C₁-C₄-アルキル)アミノ、シアノ、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示し、

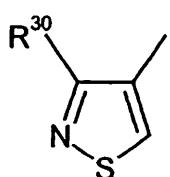
40

R²⁹はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aが式

【化 3 2】



50

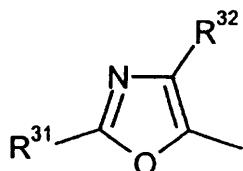
の基を示し、ここで

R³⁰はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aが式

【化33】



10

の基を示し、ここで

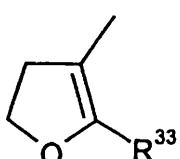
R³¹は水素、メチル又はエチルを示し、

R³²はフッ素、塩素、臭素、メチル又はエチルを示すか、

あるいは

Aが式

【化34】



20

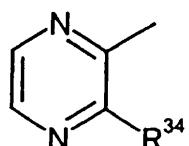
の基を示し、ここで

R³³はメチル、エチル又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aが式

【化35】



30

の基を示し、ここで

R³⁴は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル又はエチルを示す

請求項1に従う式(I)のビフェニルカルボキシアミド類。

【請求項3】

Rが水素、C₁-C₄-アルキルを示し、

Zが水素、C₁-C₄-アルキルを示し、

X及びYが互いに独立してそれぞれフッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、カルボキシル、メチル、エチル、n-プロピル、イソ-プロピル、n-ブチル、sec-ブチル、i-ブチル、tert-ブチル、トリクロロメチル、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、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、アリルオキシ、プロパルギルオキシ、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メトキシイミノメチル、エトキシイミノメチル、メトキシイミノエチル又はエトキシイミノエチルを示し、mが0～3の整数を示し、ここでmが2又は3を示す場合、Xは同一もしくは異なる基を示し、

nが0～4の数を示し、ここでnが2、3又は4を示す場合、Yは同一もしくは異なる基

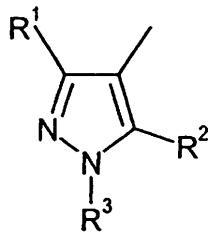
40

50

を示し、

A が式

【化 3 6】



10

の基を示し、ここで

) R¹は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、イソプロピル、モノフルオロメチル、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、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメチルチオ又はジフルオロメチルチオを示し、

R²は水素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ又はエチルチオを示し、

R³は水素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル又はフェニルを示すか、

20

あるいは

) R¹は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、エチル、イソプロピル、モノフルオロメチル、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、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメチルチオ又はジフルオロメチルチオを示し、

R²はフッ素を示し、

R³は水素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル又はフェニルを示すか、

あるいは

30

) R¹は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、イソプロピル、モノフルオロメチル、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、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメチルチオ又はジフルオロメチルチオを示し、

R²はフッ素を示し、

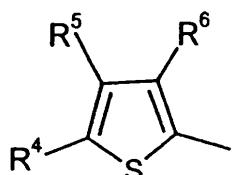
R³は水素、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル又はフェニルを示すか、

あるいは

A が式

【化 3 7】

40



の基を示し、ここで

R⁴及びR⁵は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、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又はトリクロロメチルを

50

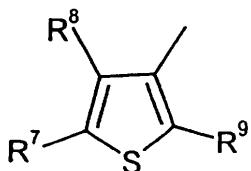
示し、

R⁶はフッ素、塩素、臭素、シアノ、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又はトリクロロメトキシを示すか、

あるいは

Aが式

【化38】



10

の基を示し、ここで

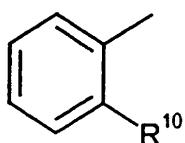
R⁷及びR⁸は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示し、

R⁹は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル又はエチルを示すか、

あるいは

Aが式

【化39】



20

の基を示し、ここで

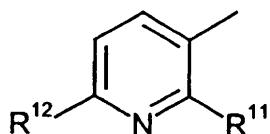
R¹⁰は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、シアノ、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、i-ブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ又はトリクロロメチルチオを示すか、

あるいは

Aが式

【化40】

30



の基を示し、ここで

40

R¹¹はフッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、シアノ、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、i-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、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、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又はトリクロロメトキシを示し、

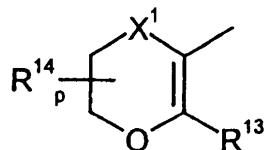
R¹²は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、i-ブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、トリクロロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ又はトリクロロメトキシを示すか、

50

トキシ、トリクロロメトキシ、メチルスルフィニル又はメチルスルホニルを示すか、
あるいは

A が式

【化 4 1】



の基を示し、ここで

10

R¹³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を示し、

R¹⁴はメチル又はエチルを示し、

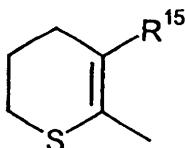
X¹は硫黄原子を示すか、SO、SO₂又はCH₂を示し、

pは0、1又は2を示すか、

あるいは

A が式

【化 4 2】



20

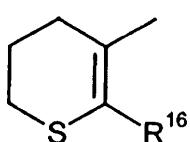
の基を示し、ここで

R¹⁵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を示すか、

あるいは

A が式

【化 4 3】



30

の基を示し、ここで

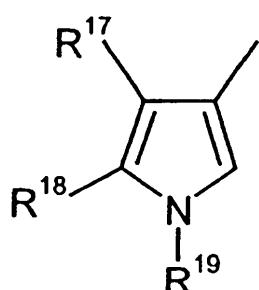
R¹⁶はメチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示すか、

あるいは

A が式

【化 4 4】

40



の基を示し、ここで

50

R¹⁷はフッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、イソプロピル、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を示し、

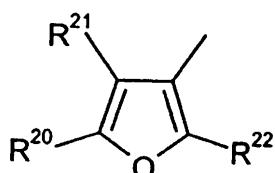
R¹⁸は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル又はトリクロロメチルを示し、

R¹⁹は水素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシメチル、エトキシメチル、ヒドロキシメチル又はヒドロキシエチルを示すか、

あるいは

Aが式

【化45】



10

の基を示し、ここで

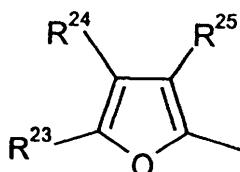
R²⁰及びR²¹は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示し、

R²²は水素、フッ素、塩素、臭素、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を示すか、

あるいは

Aが式

【化46】



20

の基を示し、ここで

30

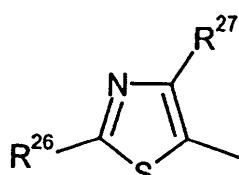
R²³及びR²⁴は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、ニトロ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示し、

R²⁵は水素、フッ素、塩素、臭素、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を示すか、

あるいは

Aが式

【化47】



40

の基を示し、ここで

R²⁶は水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、シアノ、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を示し、

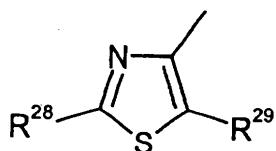
R²⁷はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示すか、

50

あるいは

A が式

【化 4 8】



の基を示し、ここで

R^{28} はフッ素、塩素、臭素、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、シアノ、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を示し、

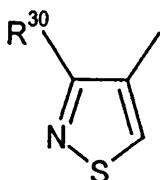
10

R^{29} はフッ素、塩素、臭素、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を示すか、

あるいは

A が式

【化 4 9】



20

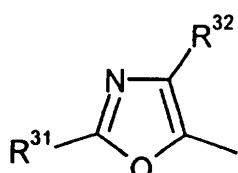
の基を示し、ここで

R^{30} はフッ素、塩素、臭素、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を示すか、

あるいは

A が式

【化 5 0】



30

の基を示し、ここで

R^{31} は水素、メチル又はエチルを示し、

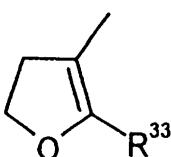
R^{32} はフッ素、塩素、臭素、メチル又はエチルを示すか、

あるいは

A が式

【化 5 1】

40



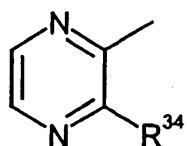
の基を示し、ここで

R^{33} 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を示すか、

あるいは

50

A が式
【化 5 2】

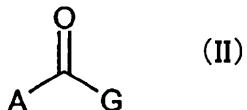


の基を示し、ここで
R³⁴は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル又はエチルを示す
請求項 1 に従う式 (I) のビフェニルカルボキシアミド類。

10

【請求項 4】

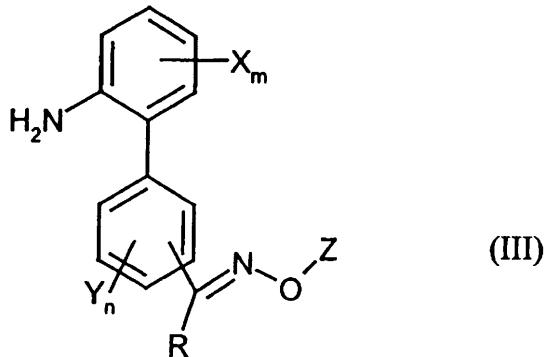
式 (II)
【化 5 3】



[式中、
A は請求項 1 で定義したとおりであり、
G はハロゲン、ヒドロキシ又は C₁ - C₆ - アルコキシを示す]
のカルボン酸誘導体を式 (III)]

20

【化 5 4】

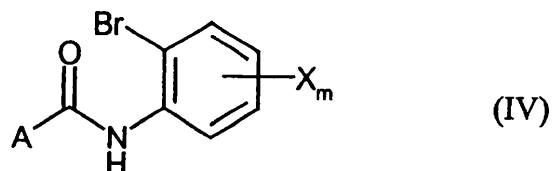


30

[式中、
R、Z、X、Y、m 及び n はそれぞれ請求項 1 で定義したとおりである]
のアニリン誘導体と、適宜触媒の存在下、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釀剤の存在下
で反応させることを特徴とする請求項 1 に従う式 (I) のビフェニルカルボキシアミド類
の製造法。

【請求項 5】

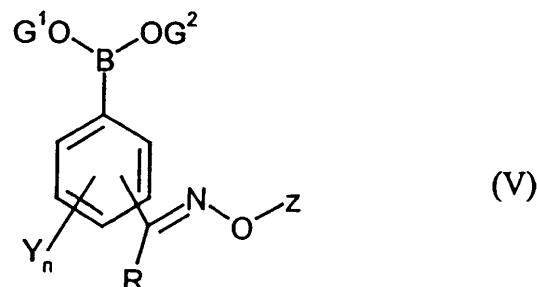
式 (IV)
【化 5 5】



40

[式中、
A、X 及び m はそれぞれ請求項 1 で定義したとおりである]
のカルボキシアミド誘導体を式 (V)]

【化56】



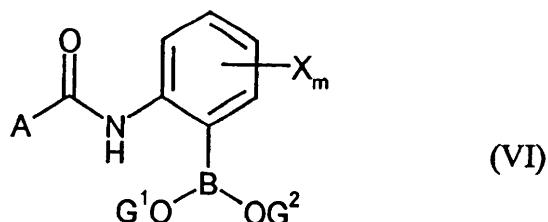
[式中、]

R、Z、Y及びnはそれぞれ請求項1で定義したとおりであり、G¹及びG²はそれぞれ水素を示すか、又は一緒になってテトラメチルエチレンを示す】のボロン酸誘導体と、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釈剤の存在下で反応させることを特徴とする請求項1に従う式(I)のビフェニルカルボキシアミド類の製造法。

【請求項6】

式(VI)

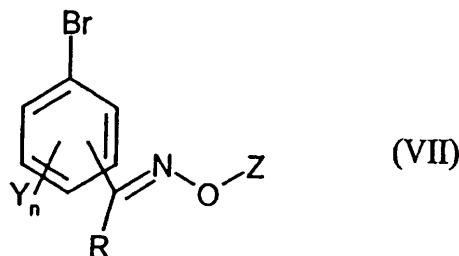
【化57】



[式中、]

A、X及びmはそれぞれ請求項1で定義したとおりであり、G¹及びG²はそれぞれ水素を示すか、又は一緒になってテトラメチルエチレンを示す】のカルボキシアミド-ボロン酸誘導体を式(VII)。

【化58】



[式中、]

R、Z、Y及びnはそれぞれ請求項1で定義したとおりである】のフェニルオキシム誘導体と、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釈剤の存在下で反応させることを特徴とする請求項1に従う式(I)のビフェニルカルボキシアミド類の製造法。

【請求項7】

式(VIII)

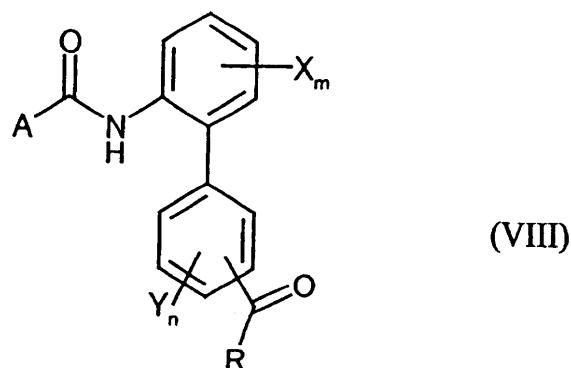
10

20

30

40

【化59】



10

[式中、]

A、R、X、Y、m及びnはそれぞれ請求項1で定義したとおりである]のビフェニルアシル誘導体を式(I-X)Z-O-NH₂ × HCl (I-X)

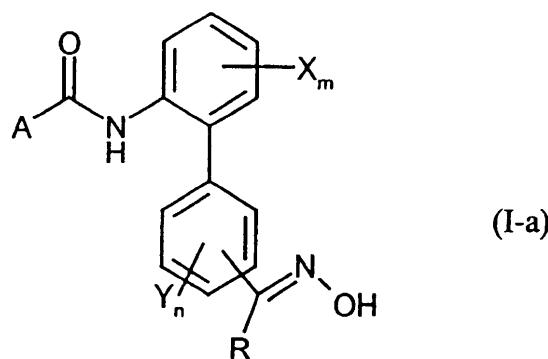
[式中、Zはそれぞれ請求項1で定義したとおりである]

のアルコキシアミンと、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釀剤の存在下で反応させることを特徴とする請求項1に従う式(I)のビフェニルカルボキシアミド類の製造法。

【請求項8】

式(I-a)

【化60】



20

30

[式中、]

A、R、X、Y、m及びnはそれぞれ請求項1で定義したとおりである]のヒドロキシアミン誘導体を式(X)Z¹-E (X)

[式中、]

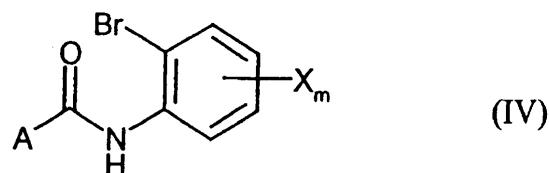
Z¹はC₁-C₆-アルキルを示し、Eは塩素、臭素、ヨウ素、メタンスルホニル又はp-トルエンスルホニルを示すか、あるいはZ¹とEは一緒にになって(C₁-C₆-アルキル)サルフェートを示す】の化合物と、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釀剤の存在下で反応させることを特徴とする請求項1に従う式(I)のビフェニルカルボキシアミド類の製造法。

【請求項9】

式(I-V)

40

【化61】

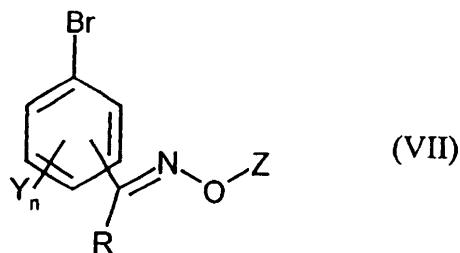


[式中、]

A、X及びmはそれぞれ請求項1で定義したとおりである]のカルボキシアミド誘導体を式(VIII)

10

【化62】



[式中、]

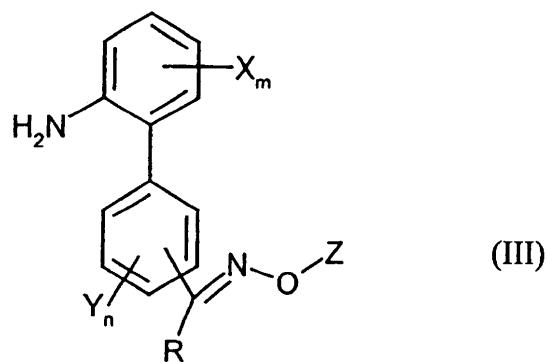
20

R、Z、Y及びnはそれぞれ請求項1で定義したとおりである]のフェニルオキシム誘導体と、パラジウムもしくは白金触媒の存在下及び4,4',4'',4',5,5',5'-オクタメチル-2,2'-ビス-1,3,2-ジオキサボロランの存在下に、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釀剤の存在下で反応させることを特徴とする請求項1に従う式(I)のビフェニルカルボキシアミド類の製造法。

【請求項10】

式(III)

【化63】



[式中、]

30

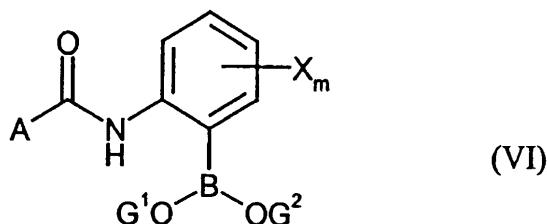
R、Z、X、Y、m及びnはそれぞれ請求項1で定義したとおりである]のアニリン誘導体。

【請求項11】

式(VI)

40

【化70】



[式中、

A、X及びmはそれぞれ請求項1で定義したとおりであり、

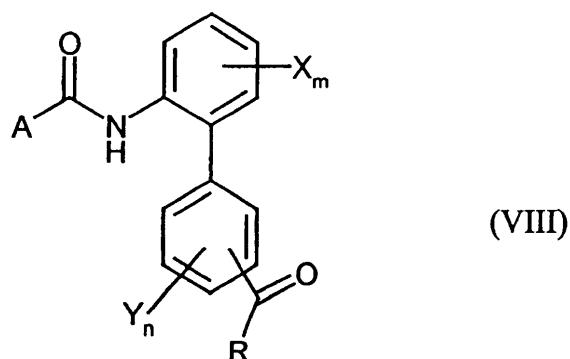
10

G¹及びG²はそれぞれ水素を示すか、又は一緒になってテトラメチルエチレンを示す]のカルボキシアミド-ボロン酸誘導体。

【請求項12】

式(VIII)

【化73】



20

[式中、

A、R、X、Y、m及びnはそれぞれ請求項1で定義したとおりである]のビフェニルアシル誘導体。

【請求項13】

少なくとも1種の請求項1に従う式(I)のビフェニルカルボキシアミドを、伸展剤及び/または界面活性剤に加えて含有することを特徴とする望ましくない微生物の抑制のための組成物。

30

【請求項14】

請求項1に従う式(I)のビフェニルカルボキシアミド類を微生物及び/又はそれらの生息場所に適用することを特徴とする望ましくない微生物の抑制法。

【発明の詳細な説明】

【0001】

本発明は新規なビフェニルカルボキシアミド類、それらの製造のための複数の方法及び望ましくない微生物の抑制のためのそれらの使用に関する。

【0002】

40

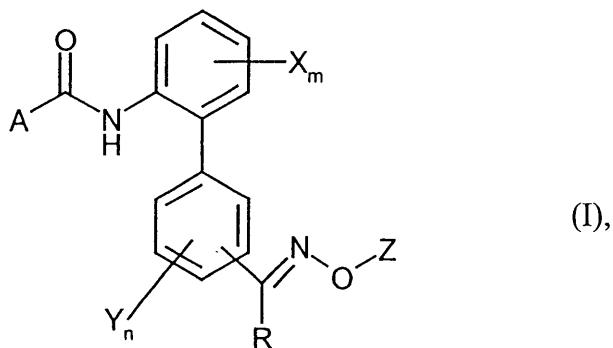
多数のカルボキシアニリド類が殺菌・殺カビ性を有することは既知である(WO 93/111117、WO 99/09013、WO 00/14071、EP-A 0 545 099及びEP-A 0 589 301を参照されたい)。これらの物質の活性は優れている;しかしながら、いくつかの場合、それは不満足である。

【0003】

今回、式(I)

【0004】

【化79】



10

【0005】

[式中、

Rは水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキルを示すか、あるいは1~5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₆ - ハロゲノアルキルを示し、

Zは水素、C₁ - C₆ - アルキルを示すか、あるいは1~5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₆ - ハロゲノアルキルを示し、

X及びYは互いに独立してそれぞれハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、カルボキシル、C₁ - C₈ - アルキル、1~5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₆ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₈ - アルコキシ、1~5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₆ - ハロゲノアルコキシ、C₁ - C₈ - アルキルチオ、1~5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₆ - ハロゲノアルキルチオ、C₂ - C₈ - アルケニルオキシ、1~5個のハロゲン原子を有するC₂ - C₈ - ハロゲノアルケニルオキシ、C₃ - C₈ - アルキニルオキシ、1~5個のハロゲン原子を有するC₃ - C₈ - ハロゲノアルキニルオキシ、C₃ - C₈ - シクロアルキル、C₁ - C₈ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₈ - アルキルスルフィニル、C₁ - C₈ - アルキルスルホニル、1~5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₈ - ハロゲノアルキルスルフィニル、1~5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₈ - ハロゲノアルキルスルホニル又はC₁ - C₆ - アルコキシミノ - C₁ - C₆ - アルキルを示し、

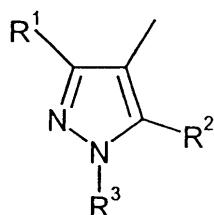
mは0~3の整数を示し、ここでmが2又は3を示す場合、Xは同一もしくは異なる基を示し、

nは0~4の整数を示し、ここでnが2、3又は4を示す場合、Yは同一もしくは異なる基を示し、

Aは式

【0006】

【化80】



40

【0007】

の基を示し、ここで

) R¹は水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、C₁ - C₄ - アルキル、1~5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、1~5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、1~5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルチオ、アミノカルボニル又はアミノカルボニル - C₁ - C₄ - アルキルを示し、

R²は水素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ

50

又は $C_1 - C_4$ - アルキルチオを示し、

R^3 は水素、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキル、 ヒドロキシ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキルチオ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルコキシ - $C_1 - C_4$ - アルキル又はフェニルを示すか、

あるいは

) R^1 は水素、 シアノ、 ハロゲン、 ニトロ、 $C_2 - C_4$ - アルキル、 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキルチオ、 アミノカルボニル又はアミノカルボニル - $C_1 - C_4$ - アルキルを示し、

R^2 はフッ素を示し、

R^3 は水素、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキル、 ヒドロキシ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキルチオ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルコキシ - $C_1 - C_4$ - アルキル又はフェニルを示すか、

あるいは

) R^1 は水素、 シアノ、 ハロゲン、 ニトロ、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキルチオ、 アミノカルボニル又はアミノカルボニル - $C_1 - C_4$ - アルキルを示し、

R^2 はフッ素を示し、

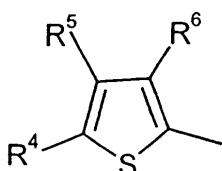
R^3 は水素、 $C_2 - C_4$ - アルキル、 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキル、 ヒドロキシ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキルチオ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ - $C_1 - C_4$ - アルキル、 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルコキシ - $C_1 - C_4$ - アルキル又はフェニルを示すか、

あるいは

A は式

【0008】

【化81】



【0009】

の基を示し、 ここで

R^4 及び R^5 は互いに独立してそれぞれ水素、 ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルキルを示し、

R^6 はハロゲン、 シアノ又は $C_1 - C_4$ - アルキルもしくは 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ - ハロゲノアルコキシを示すか、

あるいは

10

20

30

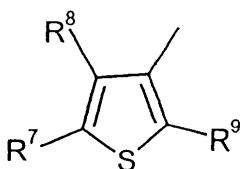
40

50

A は式

【0 0 1 0】

【化 8 2】



【0 0 1 1】

10

の基を示し、ここで

R⁷ 及び R⁸ は互いに独立してそれぞれ水素、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル又は1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルを示し、

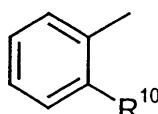
R⁹ は水素、C₁ - C₄ - アルキルを示すか、又はハロゲンを示すか、

あるいは

A は式

【0 0 1 2】

【化 8 3】



20

【0 0 1 3】

の基を示し、ここで

R¹⁰ は水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、C₁ - C₆ - アルキル、1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキル、1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルコキシを示すか、又は1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルチオを示すか、

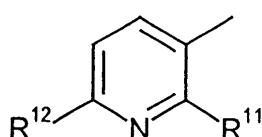
あるいは

A は式

30

【0 0 1 4】

【化 8 4】



【0 0 1 5】

の基を示し、ここで

R¹¹ はハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルチオを示すか、又は1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルコキシを示し、

R¹² は水素、ハロゲン、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルスルフィニルを示すか、又はC₁ - C₄ - アルキルスルホニルを示すか、

あるいは

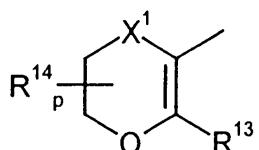
A は式

【0 0 1 6】

40

50

【化 8 5】



【0017】

の基を示し、ここで

R¹³はC₁ - C₄ - アルキルを示すか、又は1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルを示し、

10

R¹⁴はC₁ - C₄ - アルキルを示し、X¹は硫黄原子を示すか、SO、SO₂もしくはCH₂を示し、

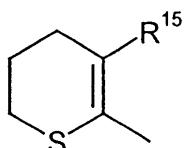
pは0、1又は2を示すか、

あるいは

Aは式

【0018】

【化 8 6】



20

【0019】

の基を示し、ここで

R¹⁵はC₁ - C₄ - アルキルを示すか、又は1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルを示すか、

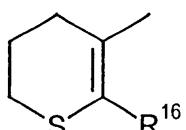
あるいは

Aは式

【0020】

【化 8 7】

30



【0021】

の基を示し、ここで

R¹⁶はC₁ - C₄ - アルキルを示すか、又は1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルを示すか、

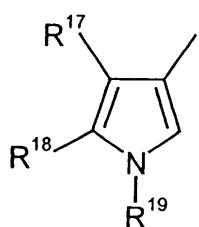
あるいは

40

Aは式

【0022】

【化 8 8】



50

【0023】

の基を示し、ここで

R^{17} はハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_4$ -アルキルを示すか、又は1~5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルを示し、

R^{18} は水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキルを示すか、又は1~5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルを示し、

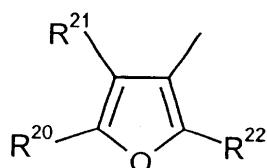
R^{19} は水素、シアノ、 $C_1 - C_4$ -アルキル、1~5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ- $C_1 - C_4$ -アルキル、ヒドロキシ- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホニル、ジ($C_1 - C_4$ -アルキル)アミノスルホニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニルを示すか、又は場合により置換されていることができるフェニルスルホニル又はベンゾイルを示すか、

あるいは

Aは式

【0024】

【化89】



10

20

【0025】

の基を示し、ここで

R^{20} 及び R^{21} は互いに独立してそれぞれ水素、ハロゲン、アミノ、 $C_1 - C_4$ -アルキルを示すか、又は1~5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルを示し、

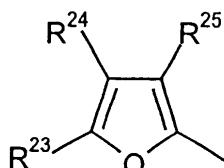
R^{22} は水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキルを示すか、又は1~5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aは式

【0026】

【化90】



30

【0027】

の基を示し、ここで

R^{23} 及び R^{24} は互いに独立してそれぞれ水素、ハロゲン、アミノ、ニトロ、 $C_1 - C_4$ -アルキルを示すか、又は1~5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルを示し、

R^{25} は水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキルを示すか、又は1~5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルを示すか、

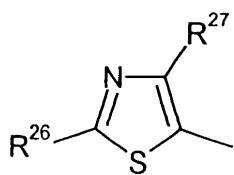
あるいは

Aは式

【0028】

【化91】

40



【0029】

の基を示し、ここで

R²⁶は水素、ハロゲン、アミノ、C₁ - C₄ - アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄ - アルキル)アミノ、シアノ、C₁ - C₄ - アルキルを示すか、又は1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルを示し、

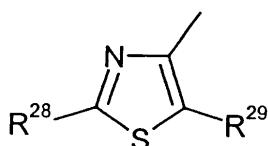
R²⁷はハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル又は1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aは式

【0030】

【化92】



20

【0031】

の基を示し、ここで

R²⁸は水素、ハロゲン、アミノ、C₁ - C₄ - アルキルアミノ、ジ - (C₁ - C₄ - アルキル)アミノ、シアノ、C₁ - C₄ - アルキルを示すか、又は1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルを示し、

R²⁹はハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル又は1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルを示すか、

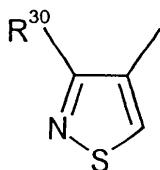
あるいは

30

Aは式

【0032】

【化93】



40

【0033】

の基を示し、ここで

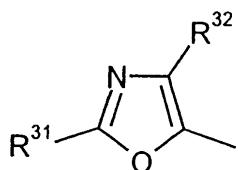
R³⁰はハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル又は1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC₁ - C₄ - ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aは式

【0034】

【化94】



【0035】

の基を示し、ここで

R<sup>31</sup>は水素又はC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルを示し、

R<sup>32</sup>はハロゲン又はC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルを示すか、

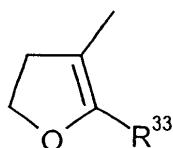
10

あるいは

Aは式

【0036】

【化95】



【0037】

20

の基を示し、ここで

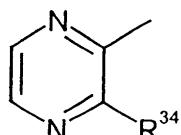
R<sup>33</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aは式

【0038】

【化96】



30

【0039】

の基を示し、ここで

R<sup>34</sup>は水素、ハロゲンを示すか、又はC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルを示す]

の新規なビフェニルカルボキシアミド類が見出された。

【0040】

さらに、式(I)のビフェニルカルボキシアミド類は、

a) 式(II)

【0041】

40

【化97】



【0042】

[式中、

Aは上記で定義したとおりであり、

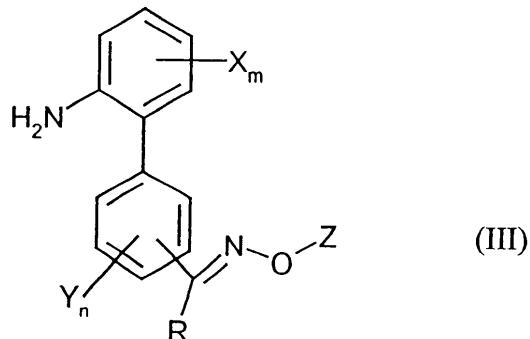
Gはハロゲン、ヒドロキシ又はC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシを示す]

50

のカルボン酸誘導体を式(III)】

【0043】

【化98】



10

【0044】

【式中、

R、Z、X、Y、m及びnはそれぞれ上記で定義したとおりである】

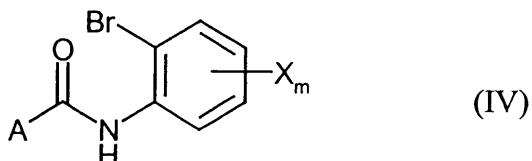
のアニリン誘導体と、適宜触媒の存在下、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釈剤の存在下で反応させるか、

あるいは

b) 式(IV)

【0045】

【化99】



20

【0046】

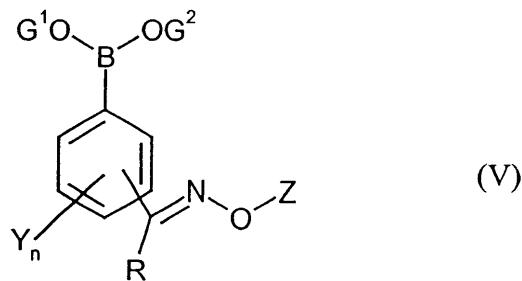
【式中、

A、X及びmはそれぞれ上記で定義したとおりである】

のカルボキシアミド誘導体を式(V)】

【0047】

【化100】



30

【0048】

【式中、

R、Z、Y及びnはそれぞれ上記で定義したとおりであり、

G¹及びG²はそれぞれ水素を示すか、又は一緒になってテトラメチルエチレンを示す】

のボロン酸誘導体と、触媒の存在下、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釈剤の存在下で反応させるか、

あるいは

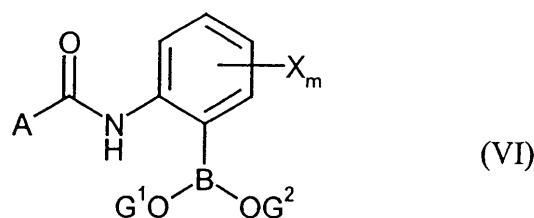
40

50

c) 式 (V I)

【0049】

【化101】



10

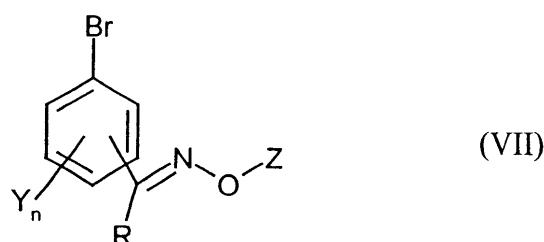
【0050】

[式中、

A、X及びmはそれぞれ上記で定義したとおりであり、
G¹及びG²はそれぞれ水素を示すか、又は一緒になってテトラメチルエチレンを示す]
のカルボキシアミド-ボロン酸誘導体を式 (V I I)

【0051】

【化102】



20

【0052】

[式中、

R、Z、Y及びnはそれぞれ上記で定義したとおりである]
のフェニルオキシム誘導体と、触媒の存在下、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釈剤の存
在下で反応させるか、

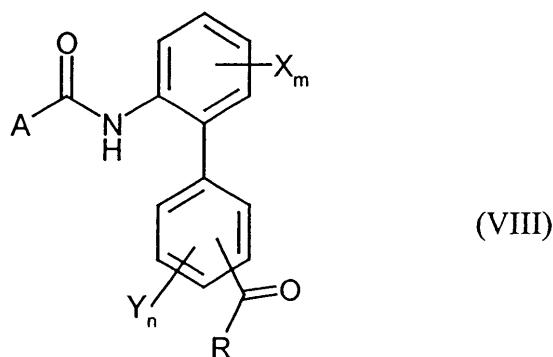
30

あるいは

d) 式 (V I I I)

【0053】

【化103】



40

【0054】

[式中、

A、R、X、Y、m及びnはそれぞれ上記で定義したとおりである]
のビフェニルアシリル誘導体を式 (IX)

Z-O-NH₂ × HCl

(IX)

50

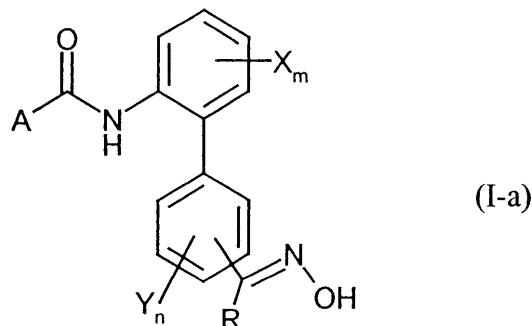
[式中、Zは上記で定義したとおりである]

のアルコキシアミンと、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釀剤の存在下で反応させるか、あるいは

e) 式(I-a)

【0055】

【化104】



10

【0056】

[式中、

A、R、X、Y、m及びnはそれぞれ上記で定義したとおりである]

のヒドロキシアミン誘導体を式(X)

20

Z¹-E (X)

[式中、

Z¹はC₁-C₆-アルキルを示し、

Eは塩素、臭素、ヨウ素、メタンスルホニル又はp-トルエンスルホニルを示すか、

あるいは

Z¹とEは一緒になってジ-C₁-C₆-アルキルサルフェートを示す]

の化合物と、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釀剤の存在下で反応させるか、

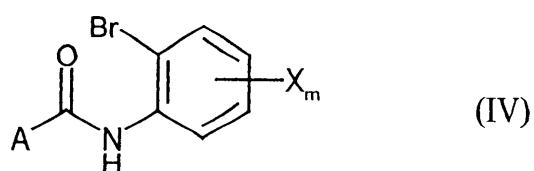
あるいは

f) 式(IV)

【0057】

【化105】

30



【0058】

[式中、

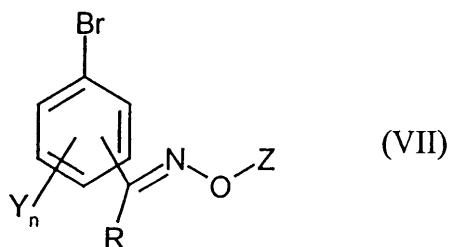
A、X及びmはそれぞれ上記で定義したとおりである]

40

のカルボキシアミド誘導体を式(VII)

【0059】

【化106】



【0060】

[式中、

10

R、Z、Y及びnはそれぞれ上記で定義したとおりである]

のフェニルオキシム誘導体と、パラジウムもしくは白金触媒の存在下及び4, 4', 4'', 4'', 5, 5', 5'', 5'' - オクタメチル-2, 2' - ビス-1, 3, 2 - ジオキサボロランの存在下に、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釈剤の存在下で反応させると得られることが見出された。

【0061】

最後に、式(I)の新規なビフェニルカルボキシアミド類が非常に優れた殺微生物性を有し、作物保護及び材料の保護の両方において、望ましくない微生物の抑制のために用いられ得ることが見出された。

【0062】

20

驚くべきことに、本発明に従う式(I)のビフェニルカルボキシアミド類は、最も類似の構造及び同じ作用傾向をもつ先行技術の活性化合物より有意に優れた殺菌・殺カビ活性を有する。

【0063】

式(I)は、本発明に従うビフェニルカルボキシアミド類の一般的定義を与えていた。

【0064】

Rは好ましくは水素、C₁-C₄-アルキル、C₃-C₆-シクロアルキルあるいは1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルキルを示す。

【0065】

Zは好ましくは水素、C₁-C₄-アルキルあるいは1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₄-ハロゲノアルキルを示す。

30

【0066】

X及びYは互いに独立してそれぞれ好ましくはフッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、カルボキシル、C₁-C₆-アルキル、1~5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、1~5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、1~5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルチオ、C₂-C₆-アルケニルオキシ、1~5個のハロゲン原子を有するC₂-C₆-ハロゲノアルケニルオキシ、C₃-C₆-アルキニルオキシ、1~5個のハロゲン原子を有するC₃-C₆-ハロゲノアルキニルオキシ、C₃-C₇-シクロアルキル、C₁-C₄-アルコキシカルボニル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₆-ハロゲノアルキルスルフィニル、1~5個のハロゲン原子を有するC₁-C₆-ハロゲノアルキルスルホニルを示すか、又はC₁-C₄-アルコキシイミノ-C₁-C₄-アルキルを示す。

40

【0067】

mは好ましくは0~3の整数を示し、ここでmが2又は3を示す場合、Xは同一もしくは異なる基を示す。

【0068】

nは好ましくは0~4の整数を示し、ここでnが2、3又は4を示す場合、Yは同一もしくは異なる基を示す。

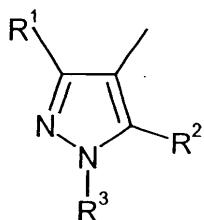
50

【0069】

Aは好ましくは式

【0070】

【化107】



10

【0071】

の基を示し、ここで

) R¹は水素、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、イソプロピル、1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルコキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、アミノカルボニル、アミノカルボニルメチル又はアミノカルボニルエチルを示し、

R²は水素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ又はエチルチオを示し、

R³は水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル又はフェニルを示すか、あるいは

) R¹は水素、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、エチル、イソプロピル、1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルコキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、アミノカルボニル、アミノカルボニルメチル又はアミノカルボニルエチルを示し、

R²はフッ素を示し、

R³は水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル又はフェニルを示すか、あるいは

) R¹は水素、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、イソプロピル、1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルコキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、アミノカルボニル、アミノカルボニルメチル又はアミノカルボニルエチルを示し、

R²はフッ素を示し、

R³は水素、エチル、n-プロピル、イソプロピル、1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル又はフェニルを示す。

【0072】

Aはさらに、好ましくは式

【0073】

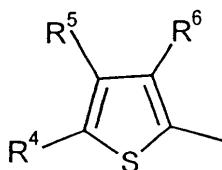
【化108】

20

30

40

50



【0074】

の基を示し、ここで

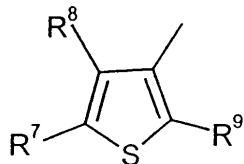
R⁴及びR⁵は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル又は1
~ 5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示し、
R⁶はフッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル又は1~5個のフッ素、塩素及び/
又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルコキシを示す。

【0075】

Aはさらに、好ましくは式

【0076】

【化109】



10

20

【0077】

の基を示し、ここで

R⁷及びR⁸は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル又は1
~ 5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示し、
R⁹は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル又はエチルを示す。

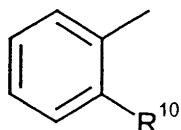
【0078】

Aはさらに、好ましくは式

【0079】

【化110】

30



【0080】

の基を示し、ここで

R¹⁰は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、シアノ、C₁-C₄-アルキル、
1~5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキル、1~
5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルコキシを示すか
、又は1~5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキル
チオを示す。

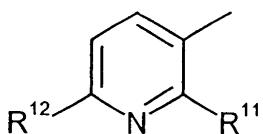
40

【0081】

Aはさらに、好ましくは式

【0082】

【化111】



【0083】

の基を示し、ここで

R¹¹はフッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、1 ~ 5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁ - C₂ - ハロゲノアルキル、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を示すか、又は1 ~ 5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁ - C₂ - ハロゲノアルコキシを示し、

R¹²は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、1 ~ 5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁ - C₂ - ハロゲノアルキル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオを示すか、1 ~ 5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁ - C₂ - ハロゲノアルコキシ、C₁ - C₂ - アルキルスルフィニル又はC₁ - C₂ - アルキルスルホニルを示す。

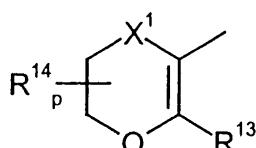
【0084】

Aはさらに、好ましくは式

【0085】

【化112】

20



【0086】

の基を示し、ここで

R¹³はメチル、エチルを示すか、又は1 ~ 5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁ - C₂ - ハロゲノアルキルを示し、

30

R¹⁴はメチル又はエチルを示し、

X¹は硫黄原子を示すか、SO、SO₂もしくはCH₂を示し、

pは0、1又は2を示す。

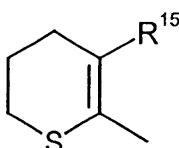
【0087】

Aはさらに、好ましくは式

【0088】

【化113】

30



40

【0089】

の基を示し、ここで

R¹⁵はメチル、エチルを示すか、又は1 ~ 5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁ - C₂ - ハロゲノアルキルを示す。

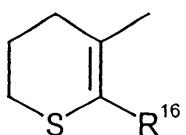
【0090】

Aはさらに、好ましくは式

【0091】

【化114】

50



【0092】

の基を示し、ここで

R¹⁶はメチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示す。

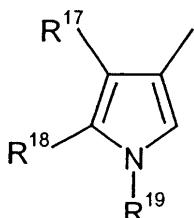
【0093】

10

Aはさらに、好ましくは式

【0094】

【化115】



20

【0095】

の基を示し、ここで

R¹⁷はフッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、イソプロピルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示し、

R¹⁸は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示し、

R¹⁹は水素、メチル、エチル、1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキル、C₁-C₂-アルコキシ-C₁-C₂-アルキル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、メチルスルホニル又はジメチルアミノスルホニルを示す。

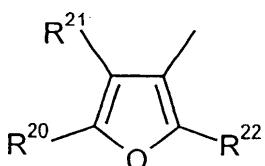
【0096】

30

Aはさらに、好ましくは式

【0097】

【化116】



【0098】

40

の基を示し、ここで

R²⁰及びR²¹は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示し、

R²²は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示す。

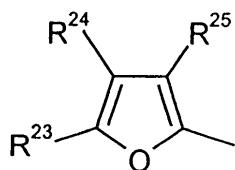
【0099】

Aはさらに、好ましくは式

【0100】

【化117】

50



【0101】

の基を示し、ここで

R²³及びR²⁴は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、ニトロ、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示し、
10

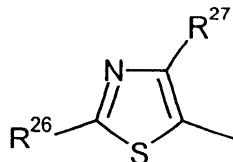
R²⁵は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示す。

【0102】

Aはさらに、好ましくは式

【0103】

【化118】



20

【0104】

の基を示し、ここで

R²⁶は水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、C₁-C₄-アルキルアミノ、ジ-(C₁-C₄-アルキル)アミノ、シアノ、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示し、

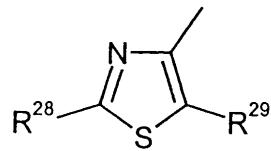
R²⁷はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示す。
30

【0105】

Aはさらに、好ましくは式

【0106】

【化119】



30

【0107】

40

の基を示し、ここで

R²⁸は水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、C₁-C₄-アルキルアミノ、ジ-(C₁-C₄-アルキル)アミノ、シアノ、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示し、

R²⁹はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示す。

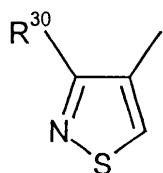
【0108】

Aはさらに、好ましくは式

【0109】

【化120】

50



【0110】

の基を示し、ここで

R³⁰はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示す。

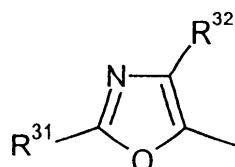
10

【0111】

Aはさらに、好ましくは式

【0112】

【化121】



20

【0113】

の基を示し、ここで

R<sup>31</sup>は水素、メチル又はエチルを示し、

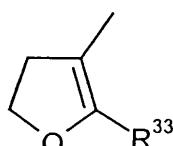
R<sup>32</sup>はフッ素、塩素、臭素、メチル又はエチルを示す。

【0114】

Aはさらに、好ましくは式

【0115】

【化122】



30

【0116】

の基を示し、ここで

R³³はメチル、エチル又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC₁-C₂-ハロゲノアルキルを示す。

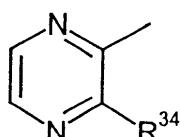
【0117】

Aはさらに、好ましくは式

【0118】

【化123】

40



【0119】

の基を示し、ここで

R<sup>34</sup>は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル又はエチルを示す。

【0120】

50

Rは特に好ましくは水素、C₁ - C₄ - アルキルを示す。

【0121】

Zは特に好ましくは水素、C₁ - C₄ - アルキルを示す。

【0122】

X及びYは互いに独立してそれぞれ特に好ましくはフッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、カルボキシリ、メチル、エチル、n-プロピル、イソ-プロピル、n-ブチル、sec-ブチル、i-ブチル、tert-ブチル、トリクロロメチル、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、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、アリルオキシ、プロパルギルオキシ、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシリ、シクロヘプチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メトキシイミノメチル、エトキシイミノメチル、メトキシイミノエチル又はエトキシイミノエチルを示す。

【0123】

mは特に好ましくは0~3の整数を示し、ここでmが2又は3を示す場合、Xは同一もしくは異なる基を示す。

【0124】

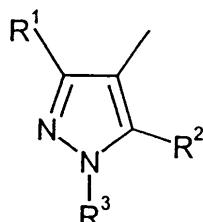
nは特に好ましくは0~4の数を示し、ここでnが2、3又は4を示す場合、Yは同一もしくは異なる基を示す。

【0125】

Aは特に好ましくは式

【0126】

【化124】



【0127】

の基を示し、ここで

) R¹は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、イソプロピル、モノフルオロメチル、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、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメチルチオ又はジフルオロメチルチオを示し、

R²は水素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ又はエチルチオを示し、

R³は水素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル又はフェニルを示すか、

あるいは

) R¹は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、エチル、イソプロピル、モノフルオロメチル、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、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメチルチオ又はジフルオロメチルチオを示し、

R²はフッ素を示し、

R³は水素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル又はフェニルを示すか、

10

20

30

40

50

あるいは

) R¹は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、イソプロピル、モノフルオロメチル、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、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメチルチオ又はジフルオロメチルチオを示し、

R²はフッ素を示し、

R³は水素、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル又はフェニルを示す。

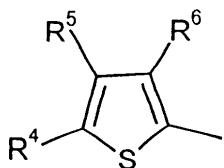
【0128】

10

Aはさらに、特に好ましくは式

【0129】

【化125】



【0130】

20

の基を示し、ここで

R⁴及びR⁵は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、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又はトリクロロメチルを示し、

R⁶はフッ素、塩素、臭素、シアノ、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又はトリクロロメトキシを示す。

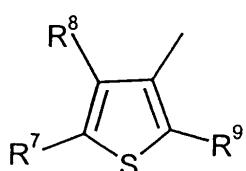
【0131】

Aはさらに、特に好ましくは式

【0132】

【化126】

30



【0133】

の基を示し、ここで

R⁷及びR⁸は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、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又はトリクロロメチルを示し、

40

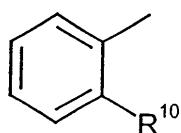
R⁹は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル又はエチルを示す。

【0134】

Aはさらに、特に好ましくは式

【0135】

【化127】



【0136】

の基を示し、ここで

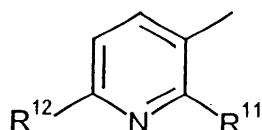
R¹⁰は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、シアノ、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、i - ブチル、sec - ブチル、tert - ブチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ又はトリクロロメチルチオを示す。 10

【0137】

Aはさらに、特に好ましくは式

【0138】

【化128】



20

【0139】

の基を示し、ここで

R¹¹はフッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、シアノ、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、i - 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、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、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又はトリクロロメトキシを示し、 30

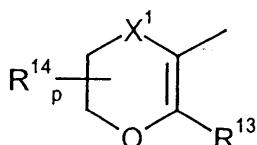
R¹²は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、i - ブチル、sec - ブチル、tert - ブチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、トリクロロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、メチルスルフィニル又はメチルスルホニルを示す。

【0140】

Aはさらに、特に好ましくは式

【0141】

【化129】



40

【0142】

の基を示し、ここで

R¹³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を示し、

R¹⁴はメチル又はエチルを示し、

X¹は硫黄原子を示すか、SO、SO₂又はCH₂を示し、

50

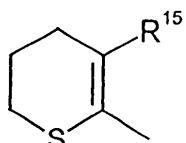
pは0、1又は2を示す。

【0143】

Aはさらに、特に好ましくは式

【0144】

【化130】



10

【0145】

の基を示し、ここで

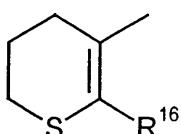
R¹⁵はメチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示す。

【0146】

Aはさらに、特に好ましくは式

【0147】

【化131】



20

【0148】

の基を示し、ここで

R¹⁶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を示す。

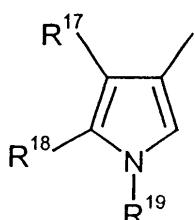
【0149】

Aはさらに、特に好ましくは式

【0150】

【化132】

30



【0151】

の基を示し、ここで

R¹⁷はフッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、イソプロピル、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を示し、

40

R¹⁸は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、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を示し、

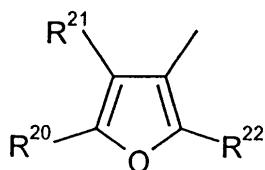
R¹⁹は水素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシメチル、エトキシメチル、ヒドロキシメチル又はヒドロキシエチルを示す。

【0152】

Aはさらに、特に好ましくは式

【0153】

【化133】



【0154】

の基を示し、ここで

R²⁰及びR²¹は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、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を示し、
10

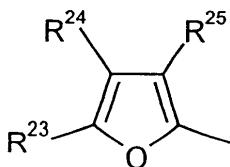
R²²は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示す。

【0155】

Aはさらに、特に好ましくは式

【0156】

【化134】



20

【0157】

の基を示し、ここで

R²³及びR²⁴は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、ニトロ、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を示し、

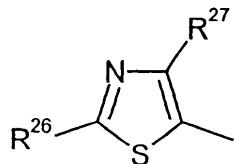
R²⁵は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示す。
30

【0158】

Aはさらに、特に好ましくは式

【0159】

【化135】



40

【0160】

の基を示し、ここで

R²⁶は水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、シアノ、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を示し、

R²⁷はフッ素、塩素、臭素、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を示す。

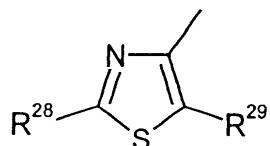
【0161】

Aはさらに、特に好ましくは式

【0162】

50

【化136】



【0163】

の基を示し、ここで

R²⁸は水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、シアノ、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を示し、10

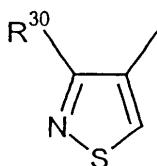
R²⁹はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示す。

【0164】

Aはさらに、特に好ましくは式

【0165】

【化137】



20

【0166】

の基を示し、ここで

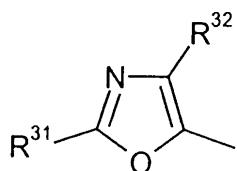
R³⁰はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示す。

【0167】

Aはさらに、特に好ましくは式

【0168】

【化138】



30

【0169】

の基を示し、ここで

R³¹は水素、メチル又はエチルを示し、40

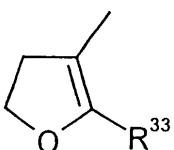
R³²はフッ素、塩素、臭素、メチル又はエチルを示す。

【0170】

Aはさらに、特に好ましくは式

【0171】

【化139】



50

【0172】

の基を示し、ここで

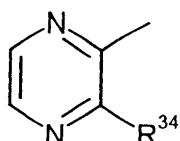
R^{33} はメチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示す。

【0173】

Aはさらに、特に好ましくは式

【0174】

【化140】



10

【0175】

の基を示し、ここで

R^{34} は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル又はエチルを示す。好ましい又は特に好ましい下に挙げた置換基を保有する化合物が好ましいか又は特に好ましい。

【0176】

アルキル又はアルケニルのような飽和もしくは不飽和炭化水素基は、例えばアルコキシにおけるように複素原子と組み合わされた場合を含んで、それぞれの場合に直鎖状もしくはこれが可能な限り分枝鎖状であることができる。

20

【0177】

場合により置換されていることができる基はモノ - もしくはポリ置換されていることができ、ポリ置換の場合、置換基は同一もしくは異なることができる。同じ表示を有する複数の基、例えば $m > 1$ の場合の m 個の基Xは、同一又は異なることができる。

【0178】

ハロゲン - 置換されている基、例えばハロゲノアルキルは、モノ - もしくはポリハロゲン化されている。ポリハロゲン化の場合、ハロゲン原子は同一もしくは異なることができる。ここでハロゲンはフッ素、塩素、臭素及びヨウ素、特にフッ素、塩素及び臭素を示す。

30

【0179】

しかしながら、上記の一般的なもしくは好ましい基の定義もしくは例示を所望通りに、すなわちそれぞれの範囲と好ましい範囲の間の組み合わせを含んで、互いに組み合わせることもできる。定義は最終的生成物ならびに対応して、前駆体及び中間体に適用される。さらに、それぞれの定義が適用されなくとも良い。

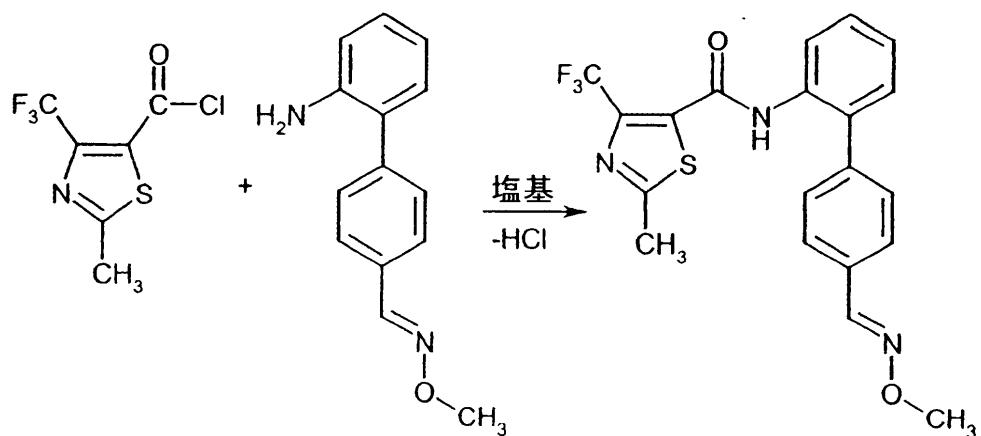
【0180】

2 - メチル - 4 - トリフルオロメチル - 1 , 3 - チアゾール - 5 - カルボニルクロリド及び2 - (4 - メトキシイミノメチル - フェニル) アニリンを出発材料として用いると、本発明に従う方法 (a) の経路を下記の式により示すことができる。

【0181】

【化141】

40



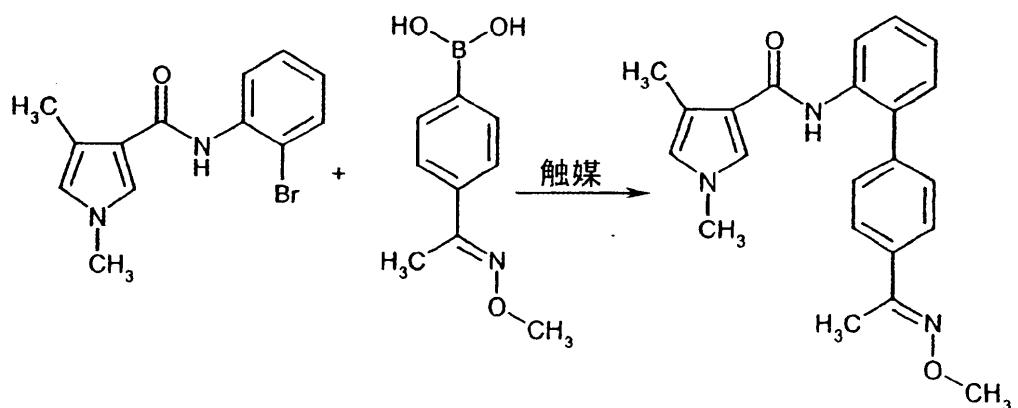
【0182】

出発材料としての2' - ブロモ - 1 , 3 - ジメチルピロール - 4 - カルボキシアニリド及び4 - メトキシイミノエチル - フェニル - ボロン酸ならびに触媒を用いると、本発明に従う方法（b）の経路を下記の式により示すことができる。

【0183】

【化142】

20



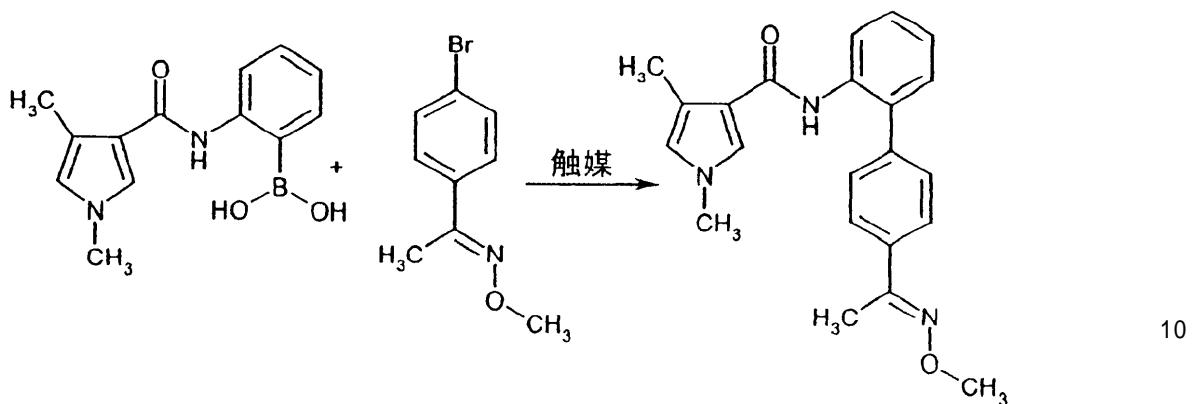
【0184】

出発材料としての2 - [(1 , 4 - ジメチルピロール - 3 - イル) カルボニルアミノ] フェニル - ボロン酸及び1 - ブロモ - 4 - メトキシイミノエチル - ベンゼンならびに触媒を用いると、本発明に従う方法（c）の経路を下記の式により示すことができる。

【0185】

【化143】

30

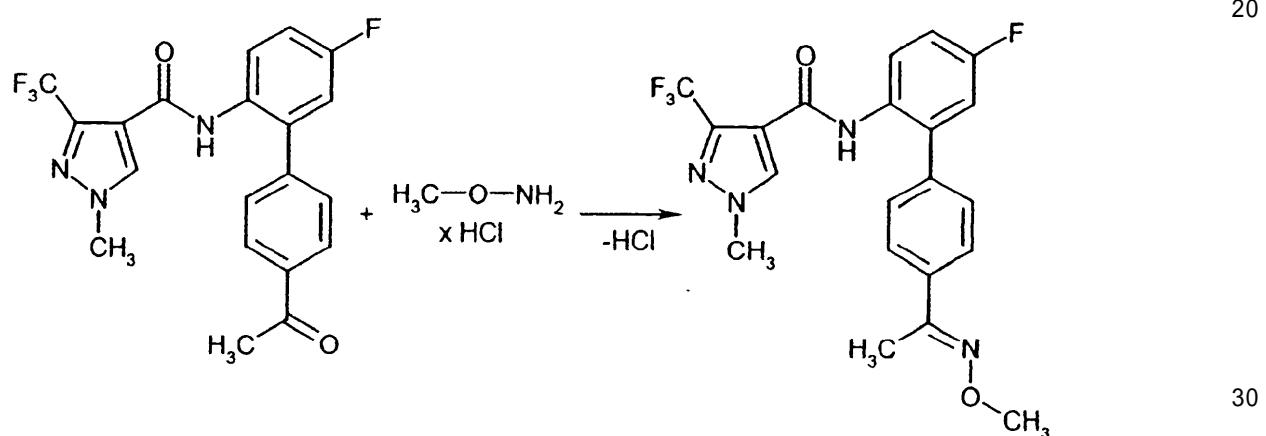


【0186】

2' - (4 - アセチル - フェニル) - 4' - フルオロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチルピラゾール - 4 - カルボキシアニリド及びメトキシアミン塩酸塩を出発材料として用いると、本発明に従う方法 (d) の経路を下記の式により示すことができる。

【0187】

【化144】

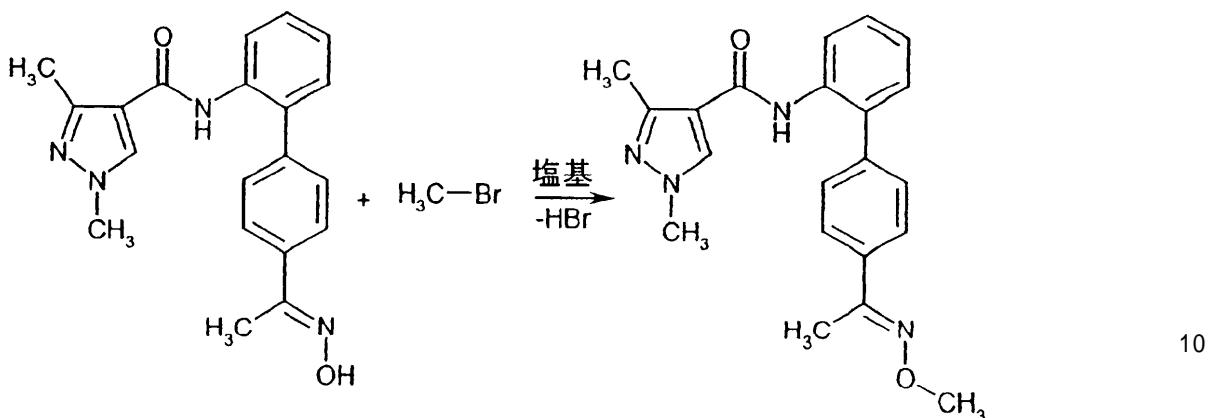


【0188】

2' - (4 - ヒドロキシイミノエチル) - フェニル - 1 , 3 - ジメチルピラゾール - 4 - カルボキシアニリド及び臭化メチルを出発材料として用いると、本発明に従う方法 (e) の経路を下記の式により示すことができる。

【0189】

【化145】



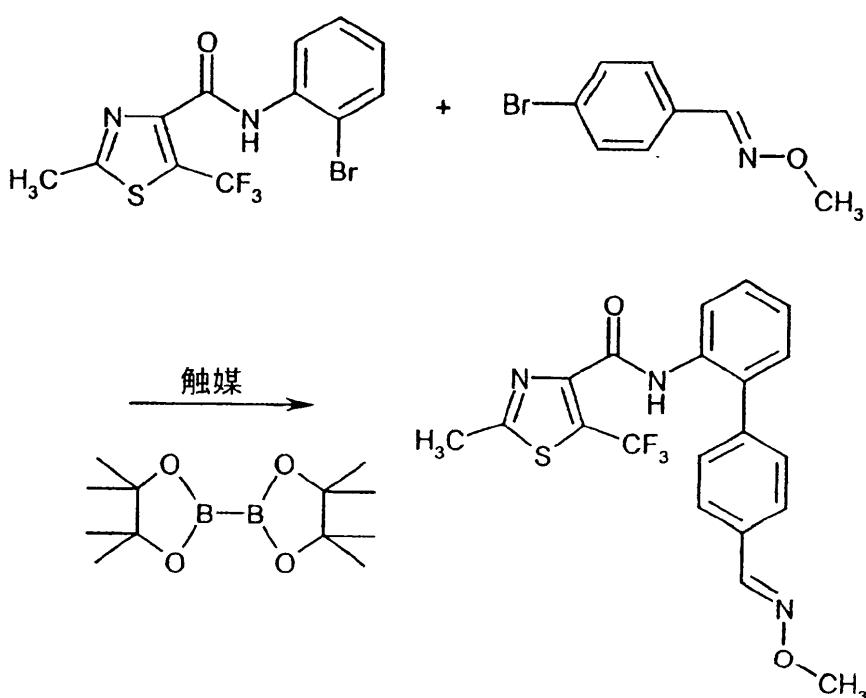
【0190】

出発材料としての 2' - ブロモ - 5 - フルオロチアゾール - 4 - カルボキシアニリド及び 1 - ブロモ - 4 - メトキシイミノメチル - ベンゼンならびに触媒及び 4 , 4 , 4' , 4' , 5 , 5 , 5' , 5' - オクタメチル - 2 , 2' - ビス - 1 , 3 , 2 - ジオキサボロランを用いると、本発明に従う方法 (f) の経路を下記の式により示すことができる。

【0191】

【化146】

20



【0192】

方法及び中間体の例示

式 (II) は本発明に従う方法 (a) を行うために出発材料として必要なカルボン酸誘導体の一般的定義を与えている。この式において、A は好ましくは本発明に従う式 (I) の物質の記述と関連して、これらの基のために好ましい又は特に好ましいとしてすでに挙げた意味を有する。G は好ましくは塩素、臭素、ヒドロキシ、メトキシ又はエトキシ、特に好ましくは塩素、ヒドロキシ又はメトキシを示す。

【0193】

式 (II) のカルボン酸誘導体は既知であるか、又は既知の方法により製造され得る (WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 300)

40

50

1 及び E P - A 0 5 8 9 3 1 3 を参照されたい)。

【0194】

式(III)は本発明に従う方法(a)を行うために反応成分として必要なアニリン誘導体の一般的定義を与えている。この式において、R、Z、X、Y、m及びnはそれぞれ好ましくは本発明に従う式(I)の物質の記述と関連して、これらの基又は表示のために好ましいもしくは特に好ましいとしてすでに挙げた意味を有する。

【0195】

式(III)のアニリン誘導体は新規である。それらのいくつかは既知の方法により製造され得る(E P - A 0 5 4 5 0 9 9 及び E P - A 0 5 8 9 3 0 1 を参照されたい)。

10

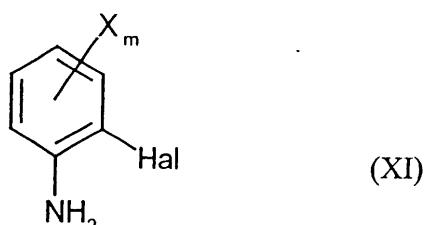
【0196】

式(III)のアニリン誘導体はさらに、

g) 一般式(XI)

【0197】

【化147】



20

【0198】

[式中、

X及びmはそれぞれ上記で定義したとおりであり、

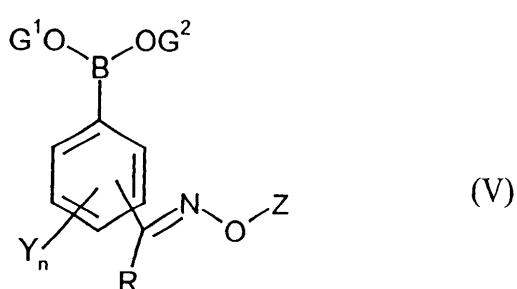
Halはハロゲンを示す]

の2-ハロゲノアニリン誘導体を式(V)

【0199】

【化148】

30



【0200】

[式中、

R、Z、Y、n、G¹及びG²はそれぞれ上記で定義したとおりである]

のボロン酸誘導体と、適宜酸結合剤の存在下及び適宜不活性有機希釈剤の存在下及び適宜触媒の存在下で反応させるか、

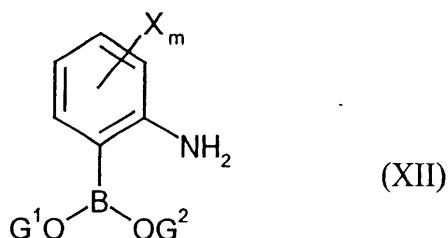
あるいは

h) 式(XII)

【0201】

【化149】

40



【0202】

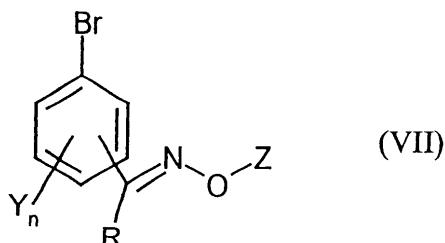
[式中、]

X、m、G¹及びG²はそれぞれ上記で定義したとおりである]
のアニリンボロン酸を式(VIII)

【0203】

【化150】

10



20

【0204】

[式中、]

R、Z、Y及びnはそれぞれ上記で定義したとおりである]
のフェニルオキシム誘導体と、適宜酸結合剤の存在下及び適宜不活性有機希釈剤の存在下
及び適宜触媒の存在下で反応させる
ことにより得られる。

【0205】

式(XI)は本発明に従う方法(g)を行うために反応成分として必要な2-ハロゲノアニリン誘導体の一般的定義を与えていた。この式において、X及びmはそれぞれ好ましくは、本発明に従う式(I)の物質の記述と関連して、これらの基又はこれらの表示のために好ましい又は特に好ましいとしてすでに挙げた意味を有する。Halは好ましくはフッ素、塩素又は臭素、特に塩素又は臭素を示す。

30

【0206】

式(XI)の2-ハロゲノアニリン誘導体は商業的に入手可能であるか又は対応するニトロ化合物から還元により製造され得る。

【0207】

式(XII)は本発明に従う方法(h)を行うために反応成分として必要なアニリンボロン酸の一般的定義を与えていた。この式において、X及びmはそれぞれ好ましくは、本発明に従う式(I)の物質の記述と関連して、これらの基又はこれらの表示のために好ましい又は特に好ましいとしてすでに挙げた意味を有する。G¹及びG²は好ましくはそれぞれ水素を示すか、又は一緒になってテトラメチルエチレンを示す。

40

【0208】

式(XII)のアニリンボロン酸は商業的に入手可能である。

【0209】

式(IV)は本発明に従う方法(b)及び(f)を行うために出発材料として必要なカルボキシアミド誘導体の一般的定義を与えていた。この式において、A、X及びmはそれぞれ好ましくは、本発明に従う式(I)の物質の記述と関連して、これらの基のために好ましい又は特に好ましいとしてすでに挙げた意味を有する。

50

【0210】

式(IV)のカルボキシアミド誘導体は既知であるか、又は既知の方法により製造され得る(WO 91/01311、EP-A 0 371 950を参照されたい)。

【0211】

式(V)は本発明に従う方法(b)及び方法(g)を行う場合に反応成分の製造のために必要なボロン酸誘導体の一般的定義を与えていた。この式において、R、Z、Y及びnはそれぞれ好ましくは、本発明に従う式(I)の物質の記述と関連して、これらの基又はこれらの表示のために好ましい又は特に好ましいとしてすでに挙げた意味を有する。G¹及びG²は好ましくはそれぞれ水素を示すか、又は一緒になってテトラメチルエチレンを示す。

10

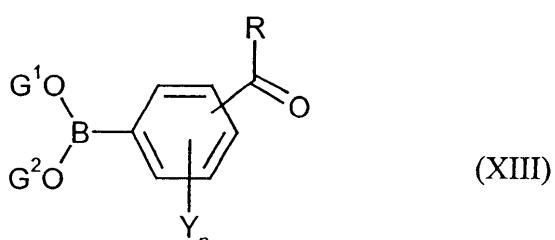
【0212】

式(V)のボロン酸誘導体は新規であり、

i) 式(XIII)

【0213】

【化151】



20

【0214】

[式中、

R、Y、n、G¹及びG²はそれぞれ上記で定義したとおりである]

のフェニルボロン酸を式(I X)

Z - O - NH₂ × HCl (IX)

[式中、

Zは上記で定義したとおりである]

30

のアルコキシアミンと、適宜酸結合剤の存在下及び適宜不活性有機希釈剤の存在下及び適宜触媒の存在下で反応させる

ことにより製造され得る。

【0215】

式(XIII)は本発明に従う方法(i)を行うために反応成分として必要なフェニルボロン酸の一般的定義を与えていた。この式において、R、Y及びnはそれぞれ好ましくは、本発明に従う式(I)の物質の記述と関連して、これらの基又はこれらの表示のために好ましい又は特に好ましいとしてすでに挙げた意味を有する。G¹及びG²は好ましくはそれぞれ水素を示すか、又は一緒になってテトラメチルエチレンを示す。

【0216】

40

式(XIII)のフェニルボロン酸は商業的に入手可能である。

【0217】

式(VI)は本発明に従う方法(c)を行うために反応成分として必要なカルボキシアミド-ボロン酸誘導体の一般的定義を与えていた。この式において、A、X及びmはそれぞれ好ましくは、本発明に従う式(I)の物質の記述と関連して、これらの基のために好ましい又は特に好ましいとしてすでに挙げた意味を有する。G¹及びG²は好ましくはそれぞれ水素を示すか、又は一緒になってテトラメチルエチレンを示す。

【0218】

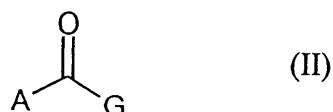
式(VI)のカルボキシアミド-ボロン酸誘導体は新規である。それらは、

j) 式(I I)

50

【0219】

【化152】



【0220】

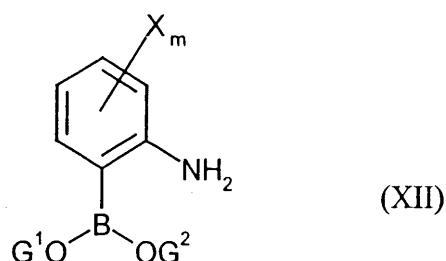
[式中、

A及びGはそれぞれ上記で定義したとおりである]
のカルボン酸誘導体を式(XIII)

10

【0221】

【化153】



20

【0222】

[式中、

X、m、G¹及びG²はそれぞれ上記で定義したとおりである]
のアニリンボロン酸と、適宜酸結合剤の存在下及び適宜不活性有機希釈剤の存在下及び適宜触媒の存在下で反応させる
ことにより製造され得る。

【0223】

式(VII)は本発明に従う方法(c)及び(f)ならびに方法(h)を行うために反応成分として必要なフェニルオキシム誘導体の一般的定義を与えている。この式において、R、Z、Y及びnはそれぞれ好ましくは、本発明に従う式(I)の物質の記述と関連して、これらの基のために好ましい又は特に好ましいとしてすでに挙げた意味を有する。

30

【0224】

式(VII)のフェニルオキシム誘導体は既知であるか、又は既知の方法により製造され得る(Synth. Commun. 2000, 30, 665-669, Synth. Commun. 1999, 29, 1697-1701を参照されたい)。

【0225】

式(VII)は本発明に従う方法(d)を行うために出発材料として必要なビフェニルアシリル誘導体の一般的定義を与えている。この式において、A、R、X、Y、m及びnはそれぞれ、本発明に従う式(I)の物質の記述と関連して、これらの基のために好ましい又は特に好ましいとしてすでに挙げた意味を有する。

40

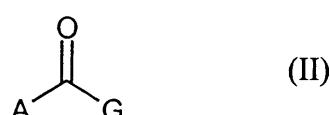
【0226】

式(VII)のビフェニルアシリル誘導体は新規である。それらは、

k)式(II)

【0227】

【化154】



50

【0228】

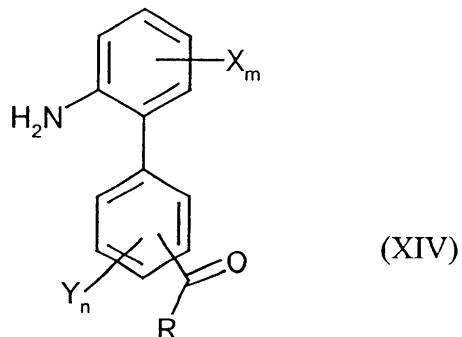
[式中、

A及びGはそれぞれ上記で定義したとおりである]

のカルボン酸誘導体を式(XIV)

【0229】

【化155】



10

【0230】

[式中、

R、X、Y、m及びnはそれぞれ上記で定義したとおりである]

の2-ベンズアルデヒド-アニリン誘導体と、適宜酸結合剤の存在下及び適宜不活性有機

20

希釈剤の存在下で反応させる

ことにより製造され得る。

【0231】

式(XIV)は本発明に従う方法(k)を行うために反応成分として必要な2-ベンズアルデヒド-アニリン誘導体の一般的定義を与えている。この式において、R、X、Y、m及びnはそれぞれ好ましくは、本発明に従う式(I)の物質の記述と関連して、これらの基のために好ましい又は特に好ましいとしてすでに挙げた意味を有する。

【0232】

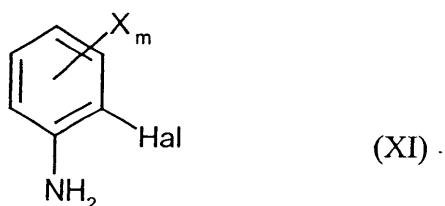
式(XIV)の2-ベンズアルデヒド-アニリン誘導体は新規である。それらは、

1)式(XI)

30

【0233】

【化156】



【0234】

40

[式中、

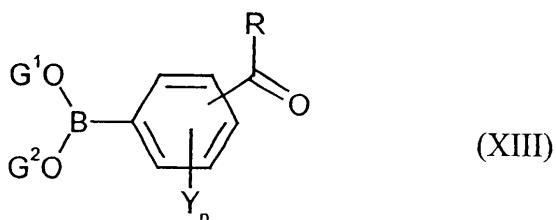
X及びmはそれぞれ上記で定義したとおりであり、

Halはハロゲンを示す]

のアニリン誘導体を式(XIII)

【0235】

【化157】



【0236】

[式中、

R、Y、n、G¹及びG²はそれぞれ上記で定義したとおりである]

10

のフェニルボロン酸誘導体と、適宜酸結合剤の存在下及び適宜不活性有機希釈剤の存在下で反応させる

ことにより製造され得る。

【0237】

方法(1)を行うために反応成分として必要な式(XI)のアニリン誘導体は、方法(g)の記述においてすでに記載した。

【0238】

方法(1)を行うために反応成分として必要な式(XIII)のフェニルボロン酸誘導体は、方法(i)の記述においてすでに記載した。

【0239】

式(IX)は本発明に従う方法(d)及び方法(i)を行うために反応成分として必要なアルコキシアミン類の一般的定義を与えている。この式において、Zは好ましくは、本発明に従う式(I)の物質の記述と関連して、この基のために好ましい又は特に好ましいとしてすでに挙げた意味を有する。記述中で挙げた塩酸塩の使用が好ましい。しかしながら、遊離のアルコキシアミン類を本発明に従う方法で用いることも可能である。

20

【0240】

式(IX)のアルコキシアミン類は商業的に入手可能である。

【0241】

式(I-a)は本発明に従う方法(e)を行うために出発材料として必要なヒドロキシアミン誘導体の一般的定義を与えている。この式において、A、R、X、Y、m及びnはそれぞれ好ましくは、本発明に従う式(I)の物質の記述と関連して、これらの基のために好ましい又は特に好ましいとしてすでに挙げた意味を有する。

30

【0242】

本発明に従う式(I-a)のヒドロキシアミン誘導体は、上記の本発明に従う方法(a)、(b)、(c)、(d)又は(f)の1つにより製造され得る。

【0243】

式(X)は本発明に従う方法(e)を行うために反応成分として必要な化合物の一般的定義を与えている。この式において、Z¹は好ましくはC₁-C₄-アルキル、特に好ましくはメチル又はエチルを示す。Eは好ましくは塩素、臭素、ヨウ素、メタンスルホニル又はp-トルエンスルホニルを示す。Eは特に好ましくは塩素又は臭素を示す。

40

【0244】

式(X)の化合物は商業的に入手可能である。

【0245】

本発明に従う方法(a)、(b)、(c)、(d)、(e)及び(f)を行うために適した酸結合剤は、それぞれの場合にそのような反応に通例であるすべての無機及び有機塩基である。アルカリ土類金属もしくはアルカリ金属水酸化物、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カルシウム、水酸化カリウムあるいはまた水酸化アンモニウム、アルカリ金属炭酸塩、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸カリウム、重炭酸ナトリウム、アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属酢酸塩、例えば酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウムならびにまた第3級アミン類、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、トリ

50

ブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジン、N-メチルピペリジン、N,N-ジメチルアミノピリジン、ジアザビシクロオクタン(DABC_O)、ジアザビシクロノネン(DBN)もしくはジアザビシクロウンデセン(DBU)を用いるのが好ましい。しかしながら、追加の酸結合剤の不在下で反応させるか、又は過剰のアミン成分を用い、それが同時に酸結合剤として作用するようにすることも可能である。

【0246】

本発明に従う方法(a)、(b)、(c)、(d)、(e)及び(f)を行うために適した希釈剤は、それぞれの場合にすべての通常の不活性有機溶媒である。場合によりハロゲン化していることができる脂肪族、脂環式もしくは芳香族炭化水素、例えば石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キシレン又はデカリン；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、ジクロロエタン又はトリクロロエタン；エーテル類、例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルt-ブチルエーテル、メチルt-アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、1,2-ジエトキシエタン又はアニソール；ニトリル類、例えばアセトニトリル、プロピオニトリル、n-もしくはi-ブチロニトリル又はベンゾニトリル；アミド類、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、N-メチルホルムアミド、N-メチルピロリドン又はヘキサメチルリン酸トリアミド；エステル類、例えば酢酸メチル又は酢酸エチル、スルホキシド類、例えばジメチルスルホキシドあるいはスルホン類、例えばスルホランを用いるのが好ましい。

10

20

【0247】

本発明に従う方法(a)、(b)、(c)、(d)、(e)及び(f)を行う場合、反応温度はそれぞれの場合に比較的広い範囲内で変わることができる。一般に方法は0～140、好ましくは10～120の温度で行われる。

【0248】

本発明に従う方法(a)、(b)、(c)、(d)、(e)及び(f)は一般に、それぞれの場合に大気圧下で行われる。しかしながら、それぞれの場合に、加圧もしくは減圧下で行うこともできる。

【0249】

本発明に従う方法(a)を行う場合、式(I I)の酸ハライドのモル当たり一般に1モルあるいはまた過剰の式(I I I)のアニリン誘導体及び1～3モルの酸結合剤が用いられる。しかしながら、反応成分を他の比率で用いることもできる。仕上げは通常の方法により行われる。一般に反応混合物を水で処理し、有機相を分離し、乾燥後に減圧下で濃縮する。残る残留物から適宜クロマトグラフィー又は再結晶のような通常の方法により、まだ存在し得る不純物を除去することができる。

30

【0250】

本発明に従う方法(b)を行う場合、式(I V)のカルボキシアミドのモル当たり一般に1モルあるいはまた過剰の式(V)のボロン酸誘導体及び1～5モルの酸結合剤が用いられる。しかしながら、反応成分を他の比率で用いることもできる。仕上げは通常の方法により行われる。一般に反応混合物を水で処理し、沈殿を分離し、乾燥する。残る残留物から適宜クロマトグラフィー又は再結晶のような通常の方法により、まだ存在し得る不純物を除去することができる。

40

【0251】

本発明に従う方法(c)を行う場合、式(V I)のカルボキシアミド-ボロン酸誘導体のモル当たり一般に1モルあるいはまた過剰の式(V I I)のフェニルオキシム誘導体及び1～10モルの酸結合剤及び0.5～5モルパーセントの触媒が用いられる。しかしながら、反応成分を他の比率で用いることもできる。仕上げは通常の方法により行われる。一般に反応混合物を水で処理し、沈殿を分離し、乾燥する。残る残留物から適宜クロマトグラフィー又は再結晶のような通常の方法により、まだ存在し得る不純物を除去することができる。

50

【0252】

本発明に従う方法(d)を行う場合、式(VIII)のビフェニルアシル誘導体のモル当たり一般に1モルあるいはまた過剰の式IXのアルコキシアミン及び1~5モルの酸結合剤が用いられる。しかしながら、反応成分を他の比率で用いることもできる。仕上げは通常の方法により行われる。一般に反応混合物を水で処理し、沈殿を分離し、水及びジイソプロピルエーテルで洗浄し、次いで乾燥する。残る残留物から適宜クロマトグラフィー又は再結晶のような通常の方法により、まだ存在し得る不純物を除去することができる。

【0253】

本発明に従う方法(e)を行う場合、式(I-a)のヒドロキシアミン誘導体のモル当たり一般に1モルあるいはまた過剰の式Xの試薬及び1~5モルの酸結合剤が用いられる。しかしながら、反応成分を他の比率で用いることもできる。仕上げは通常の方法により行われる。一般に反応混合物を水で処理し、沈殿を分離し、乾燥する。残る残留物から適宜クロマトグラフィー又は再結晶のような通常の方法により、まだ存在し得る不純物を除去することができる。10

【0254】

本発明に従う方法(f)を行う場合、式(IV)のカルボキシアミド誘導体のモル当たり一般に1モルあるいはまた過剰の式(VII)のフェニルオキシム誘導体及び1~5モルの酸結合剤及び1~5モルの触媒が用いられる。しかしながら、反応成分を他の比率で用いることもできる。仕上げは通常の方法により行われる。一般に反応混合物を水で処理し、沈殿を分離し、乾燥する。残る残留物から適宜クロマトグラフィー又は再結晶のような通常の方法により、まだ存在し得る不純物を除去することができる。20

【0255】

本発明に従う物質は有力な殺微生物活性を有し、作物保護及び材料の保護において、菌・カビ及びバクテリアのような望ましくない微生物の抑制のために用いられ得る。

【0256】

殺菌・殺カビ剤(fungicides)を作物保護においてネコブカビ類(Plasmoidiophoromycetes)、卵菌類(Oomycetes)、ツボカビ類(Cytridiomycetes)、接合菌類(Zygomycetes)、子囊菌類(Ascomycetes)、坦子菌類(Basidiomycetes)及び不完全菌類(Deuteromycetes)の抑制に用いることができる。30

【0257】

殺バクテリア剤を作物保護においてシードモナス(Pseudomonadaceae)、リゾビウム(Rhizobiaceae)、腸内細菌(Enterobacteriaceae)、コリネバクテリウム(Corynebacteriaceae)及びストレプトミセス(Streptomyctaceae)の抑制に用いることができる。

【0258】

上記の一般名の下に含まれる菌・カビ性及びバクテリア性の病気を引き起こすいくつかの病原体を、制限としてではなく、例として挙げることができる：

キサントモナス(Xanthomonas)種、例えばキサントモナス・カムベスツリスpv.オリザエ(Xanthomonas campestris pv. oryzae)；40

シードモナス(Pseudomonas)種、例えばシードモナス・シリングエpv.ラクリマンス(Pseudomonas syringae pv. lachrymans)；

エルウィニア(Erwina)種、例えばエルウィニア・アミロボラ(Erwina amylovora)；

ピチウム(Pythium)種、例えばピチウム・ウルチマム(Pythium ultimum)；

フィトフトラ(Phytophthora)種、例えばフィトフトラ・インフェスタンス(50

Phytophthora infestans) ;
 シュードペロノスボラ(*Pseudoperonospora*)種、例えばシュードペロ
 ノスボラ・ヒュミリ(*Pseudoperonospora humilis*)又はシュード
 ペロノスボラ・クベンシス(*Pseudoperonospora cubensis*)
 ;
 プラスモバラ(*Plasmopara*)種、例えばプラスモバラ・ヴィチコラ(*Plasmopara viticola*) ;
 ブレミア(*Bremia*)種、例えばブレミア・ラクトカエ(*Bremia lactucae*) ;
 ペロノスボラ(*Peronospora*)種、例えばペロノスボラ・ピシ(*Peronospora pisici*)又はP. ブラシカエ(*P. brassicae*) ;
 エリシフェ(*Erysiphe*)種、例えばエリシフェ・グラミニス(*Erysiphe graminis*) ;
 スファエロテカ(*Sphaerotheca*)種、例えばスファエロテカ・フリギネア(*Sphaerotheca fuliginea*) ;
 ポドスファエラ(*Podosphaera*)種、例えばポドスファエラ・ロイコトリチャ(*Podosphaera leucotricha*) ;
 ベンチュリア(*Venturia*)種、例えばベンチュリア・イナエクアリス(*Venturia inaequalis*) ;
 ピレノフォラ(*Pyrenophora*)種、例えばピレノフォラ・テレス(*Pureno phora teres*)又はP. グラミネア(*P. graminea*)
 (分生子(*Conidium*)型 : ドレチュスレラ(*Drechslera*)、Syn:ヘルミ
 ントスボリウム(*Helminthosporium*)) ;
 コクリオボルス(*Cochliobolus*)種、例えばコクリオボルス・サチブス(*Cochliobolus sativus*)
 (分生子型 : ドレチュスレラ、Syn:ヘルミントスボリウム) ;
 ウロミセス(*Uromyces*)種、例えばウロミセス・アベンディクラツス(*Uromyces appendiculatus*) ;
 プクシニア(*Puccinia*)種、例えばプクシニア・レコンディタ(*Puccinia recondita*) ;
 スクレロチニア(*Sclerotinia*)種、例えばスクレロチニア・スクレロチオル
 ム(*Sclerotinia sclerotiorum*) ;
 チレチア(*Tilletia*)種、例えばチレチア・カリエス(*Tilletia caries*) ;
 ウスチラゴ(*Ustilago*)種、例えばウスチラゴ・ヌダ(*Ustilago nudans*)又はウスチラゴ・アヴェナエ(*Ustilago avenae*) ;
 ペリクラリア(*Pellicularia*)種、例えばペリクラリア・ササキイ(*Pellicularia sasakii*) ;
 ピリクラリア(*Pyricularia*)種、例えばピリクラリア・オリザエ(*Pyricularia oryzae*) ;
 フサリウム(*Fusarium*)種、例えばフサリウム・クルモルム(*Fusarium culmorum*) ;
 ハイイロカビ(*Botrytis*)種、例えばボツリチス・シネレア(*Botrytis cinerea*) ;
 セプトリア(*Septoria*)種、例えばセプトリア・ノドルム(*Septoria nodorum*) ;
 レプトスファエリア(*Leptosphaeria*)種、例えばレプトスファエリア・ノ
 ドルム(*Leptosphaeria nodorum*) ;
 セルコスボラ(*Cercospora*)種、例えばセルコスボラ・カネセンス(*Cercospora canescens*) ;

10

20

30

40

50

アルテルナリア(*Alternaria*)種、例えばアルテルナリア・ブラシカエ(*Alternaria brassicace*)；及び
シュードセルコスボレラ(*Pseudocercosporaella*)種、例えばシードセルコスボレラ・ヘルポトリコイデス(*Pseudocercosporaella heteropotrichoides*)。

【0259】

活性化合物が植物の病気の抑制に必要な濃度において植物により十分に許容されるという事実は、植物の地上部分、増殖茎及び種子ならびに土壤を処理することを可能にする。

【0260】

本発明に従う活性化合物をブドウ栽培ならびに果実及び野菜栽培における病気の抑制に、例えばベンチュリア、ボツリチス、スクレロチニア、リゾクトニア、ウンシヌラ、スファエロテカ、ポドスファエラ、アルテルナリア及びコレトツリクム種に対して用いて特に成功することができる。稻の病気、例えばピリクラリア及びペリクラリア種は同様に良好な結果を以って抑制される。

10

【0261】

本発明に従う活性化合物は作物の収穫を増加させるためにも適している。さらに、それらは毒性が低下しており、植物により十分に許容される。

【0262】

本発明に従い、植物全体及び植物の一部を処理することができる。本明細書では植物により、望まれている及び望まれていない野生植物もしくは作物植物（天然に存在する作物植物を含む）のようなすべての植物及び植物集団が理解される。作物植物は通常の育種及び最適化法により、あるいは生物工学的及び遺伝子工学的方法により、あるいはこれらの方法の組み合わせにより得られ得る植物ができる、形質転換植物を含み且つ品種所有権により保護され得るか、又はされ得ない植物品種を含む。植物の一部は植物のすべての地上及び地下部分ならびに器官、例えば苗条、葉、花及び根を意味すると理解されるべきであり、挙げができる例は葉、針、茎、幹、花、子実体、果実及び種子ならびにまた根、塊茎及び根茎である。植物の一部は収穫された植物ならびに栄養及び有性増殖材料、例えば実生、塊茎、根茎、挿し木及び種子も含む。

20

【0263】

材料の保護において、本発明に従う化合物を望ましくない微生物による攻撃及び破壊に対して工業材料を保護するために用いることができる。

30

【0264】

本明細書に関して工業材料は、工業において用いるために準備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に従う活性化合物により保護されるべきことが意図されている工業材料は接着剤、サイズ剤、紙及び板紙、編織布、皮革、木材、塗料及びプラスチック製品、冷却潤滑剤ならびに微生物により攻撃又は破壊され得る他の材料であることができる。微生物の増殖により損傷を受け得る製造プラントの部品、例えば冷却水回路も保護されるべき材料の範囲内に挙げることができる。本発明の範囲内に挙げられ得る工業材料は、好ましくは接着剤、サイズ剤、紙及び板紙、皮革、木材、塗料、冷却潤滑剤及び熱媒液、特に好ましくは木材である。

40

【0265】

挙げができる工業材料を分解するか又は変化させることができる微生物は例えばバクテリア、菌・カビ、酵母、藻類及び粘液生物である。本発明に従う活性化合物は好ましくは菌・カビ、特にカビならびに木材・変色性及び木材・破壊性菌・カビ（奨子菌類）に対して、ならびに粘液生物及び藻類に対して作用する。

【0266】

例として下記の属の微生物を挙げることができる：

アルテルナリア(*Alternaria*)、例えばアルテルナリア・テヌイス(*Alternaria tenuis*)、

アスペルギルス(*Aspergillus*)、例えばアスペルギルス・ニゲル(*Aspergillus niger*)

50

rgillus niger)、
 カエトミウム (*Chartomium*)、例えばカエトミウム・グロボスム (*Chaetomium globosum*)、
 コニオフォラ (*Coniophora*)、例えばコニオフォラ・プエタナ (*Coniophora puetana*)、
 レンチヌス (*Lentinus*)、例えばレンチヌス・チグリヌス (*Lentinus tigrinus*)、
 ペニシリウム (*Penicillium*)、例えばペニシリウム・グラウクム (*Penicillium glaucum*)、
 ポリポルス (*Polyporus*)、例えばポリポルス・ベルシコロル (*Polyporus versicolor*)、¹⁰
 オウレオバシジウム (*Aureobasidium*)、例えばオウレオバシジウム・ブルランス (*Aureobasidium pullulans*)、
 スクレロフォマ (*Sclerophoma*)、例えばスクレロフォマ・ピチオフィラ (*Sclerophoma pityophila*)、
 トリコデルマ (*Trichoderma*)、例えばトリコデルマ・ビリデ (*Trichoderma viride*)、
 エシェリキア (*Escherichia*)、例えばエシェリキア・コリ (*Escherichia coli*)、
 シュードモナス (*Pseudomonas*)、例えばシュードモナス・アエルギノサ (*Pseudomonas aeruginosa*) 及び²⁰
 スタフィロコックス (*Staphylococcus*)、例えばスタフィロコックス・アウレウス (*Staphylococcus aureus*)。

【0267】

活性化合物の特定の物理的及び / 又は化学的性質に依存して、それらを通常の調剤、例えば溶液、乳剤、懸濁剤、粉剤、泡剤、塗布剤、顆粒剤、エアゾールならびにポリマー物質中及び種子用のコーティング組成物中にマイクロカプセル封入された形態ならびに U L V 冷及び温霧調剤に転換することができる。

【0268】

これらの調剤は既知の方法で、例えば活性化合物を伸展剤、すなわち液体溶媒、圧力下で液化された気体及び / 又は固体担体と、場合によっては界面活性剤、すなわち乳化剤及び / 又は分散剤及び / 又は発泡剤を用いて混合することにより調製される。用いられる伸展剤が水の場合、例えば補助溶媒として有機溶媒を用いることもできる。本質的に適した液体溶媒は：芳香族化合物、例えばキシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族化合物又は塩素化脂肪族炭化水素、例えばクロロベンゼン、クロロエチレン又は塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えばシクロヘキサン又はパラフィン類、例えば石油留分、アルコール類、例えばブタノール又はグリコールならびにそれらのエーテル類及びエステル類、ケトン類、例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサン、強力に極性の溶媒、例えばジメチルホルムアミドもしくはジメチルスルホキシド、あるいはまた水である。液化された気体状の伸展剤又は担体は、標準温度において且つ大気圧下で気体状である液体、例えばエアゾールプロペラント、例えばハロゲン化炭化水素あるいはまたブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素を意味すると理解されるべきである。適した固体担体は：例えばカオリン、クレー、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モントモリロナイト又はケイソウ土のような粉碎された天然鉱石ならびに微粉碎されたシリカ、アルミナ及びケイ酸塩のような粉碎された合成鉱石である。顆粒剤に適した固体担体は：例えば方解石、大理石、軽石、海泡石及び白雲石のような粉碎されて分別された天然岩石、あるいはまた無機及び有機粉末の合成顆粒ならびにおが屑、ココヤシの殻、とうもろこしの穂軸及びタバコの茎のような有機材料の顆粒である。適した乳化剤及び / 又は発泡剤は：例えば非イオン性及びアニオン性乳化剤、例えばポリオキシエチレン脂肪酸エステル類、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル類、例えばア³⁰
⁴⁰
⁵⁰

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類、アルキルサルフェート類、アリールスルホネート類、あるいはまたタンパク質加水分解産物である。適した分散剤は：例えばリグニン・サルファイト廃液及びメチルセルロースである。

【0269】

粘着付与剤、例えばカルボキシメチルセルロースならびに粉末、顆粒もしくはラテックスの形態の天然及び合成ポリマー、例えばアラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニル、あるいはまたセファリン及びレシチンのような天然リン脂質ならびに合成リン脂質を調剤中で用いることができる。他の可能な添加剤は鉛油及び植物油であることができる。

【0270】

着色料、例えば酸化鉄、酸化チタン及びブルシャンブルーのような無機顔料ならびにアリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料のような有機染料ならびに鉄、マンガン、ほう素、銅、コバルト、モリブデン及び亜鉛の塩のような微量栄養素を使用することができる。

【0271】

調剤は一般に0.1～9.5重量パーセント、好ましくは0.5～9.0重量%の活性化合物を含む。

【0272】

本発明に従う活性化合物をそのまで用いることができるか、あるいは既知の殺菌・殺力ビ剤、殺バクテリア剤(bactericides)、殺ダニ剤(acaricides)、殺線虫剤(nematicides)又は殺虫剤(insecticides)とも混合されたその調剤中で用い、例えば活性範囲を広げるか、又は耐性の発現を妨げることができる。多くの場合に相乗効果が得られ、すなわち混合物の活性は個々の成分の活性より高い。

【0273】

適した混合パートナーの例は以下である：

殺菌・殺力ビ剤：

アルジモルフ、アンプロピルフォス、アンプロピルフォス カリウム、アンドプリム、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、ベンザマクリル、ベンザマクリル-イソブチル、
ビアラフォス、ビナパクリル、ビフェニル、ビテルタノル、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、
カルシウムポリスルフィド、カプシマイシン、カプタフォル、カプタン、カルベンダジン、
カルボキシン、カルボン、キノメチオネット、クロベンチアゾン、クロルフェナゾール、
クロロネブ、クロロピクリン、クロロタロニル、クロゾリネット、クロジラコン、クフラネブ、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、
デバカルブ、ジクロロフェン、ジクロブトラゾール、ジクロフルアニド、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、ジメチリモル、ジメトモルフ、
ジニコナゾール、ジニコナゾール-M、ジノカブ、ジフェニルアミン、ジピリチオン、ジタリンフォス、ジチアノン、ドデモルフ、ドジン、ドラゾキソロン、
エジフェンフォス、エポキシコナゾール、エタコナゾール、エチリモル、エツリジアゾール、

ファモキサドン、フェナパニル、フェナリモル、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェニトロパン、フェンピクロニル、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、フェンチンアセテート、フェンチンヒドロキシド、フェルバム、フェリムゾン、フルアジナム、フルメトベル、フルオロミド、フルクインコナゾール、フルルブリミドル、フルシラゾール、フルスルファミド、フルトラニル、フルツリアフォル、フォルペト、フォセチル-アルミニウム、フォセチル-ナトリウム、フタリド、フベリダゾール、フララキシル、フラメツピル、フルカルボニル、フルコナゾール、フルコナゾール-シス、フルメシクロクス、
グアザチン、

10

20

30

40

50

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、イミノクタジン アルベシレート、
 イミノクタジン トリアセテート、イオドカルブ、イプコナゾール、イプロベンフォス (I B P)、イプロジョン、イルママイシン、イソプロチオラン、イソバレジオン、
 カスガマイシン、クレスキシム - メチル、銅調剤、例えば：水酸化銅、ナフテン酸銅、オ
 キシ塩化銅、硫酸銅、酸化銅、オキシン - 銅及びボルドー混合物、
 マンコッパー、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、メツコナゾール、メタルホカルブ、メトフロキサム、メチラム、メトメクラ
 ム、メトルホバクス、ミルジオマイシン、ミクロブタニル、ミクロゾリン、
 ニッケルジメチルジチオカルバメート、ニトロタル - イソプロピル、ヌアリモル、
 10 オフレース、オキサジキシル、オキサモカルブ、オキソリニン酸、オキシカルボキシム、
 オキシフェンチイン、
 パクロブトラゾール、ペフラゾエート、ペンコナゾール、ペンシクロン、オスジフェン
 、ピマリシン、ピペラリン、ポリオキシン、ポリオキソリム、プロベナゾール、プロクロ
 ラツ、プロシミドン、プロパモカルブ、プロパノシン - ナトリウム、プロピコナゾール、
 プロピネブ、ピラゾフォス、ピリフェノクス、ピリメタニル、ピロクイロン、ピロキシフル、
 クインコナゾール、クイントゼン (PCNB)、キノキシフェン、
 硫黄及び硫黄調剤、
 20 テブコナゾール、テクロフタラム、テクナゼン、テツシクラシス、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、トルクロフォス - メチル、トリルフルアニド、トリアジメフォン、トリアジメ
 ノル、トリアツブチル、トリアゾキシド、トリクラミド、トリシクラゾール、トリデモル
 フ、トリフルミゾール、トリフォリン、トリチコナゾール、
 ユニコナゾール、
 バリダマイシン A、ピンクロゾリン、ビニコナゾール、
 ザリラミド、ジネブ、ジラムならびに又
 Dagger G、OK - 8705、OK - 8801、
 - (1, 1 - ジメチルエチル) - - (2 - フェノキシエチル) - 1H - 1, 2, 4 -
 トリアゾール - 1 - エタノール、
 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - - フルオロ - - プロピル - 1H - 1, 2, 4 -
 30 トリアゾール - 1 - エタノール、
 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - - メトキシ - - メチル - 1H - 1, 2, 4 - ト
 リアゾール - 1 - エタノール、
 - (5 - メチル - 1, 3 - ジオキサン - 5 - イル) - - [[4 - (トリフルオロメチ
 ル) - フェニル] - メチレン] - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - エタノール、
 (5RS, 6RS) - 6 - ヒドロキシ - 2, 2, 7, 7 - テトラメチル - 5 - (1H - 1
 , 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) - 3 - オクタノン、
 (E) - - (メトキシイミノ) - N - メチル - 2 - フェノキシ - フェニルアセトアミド
 40 、
 1 - イソプロピル { 2 - メチル - 1 - [[[1 - (4 - メチルフェニル) - エチル] - ア
 ミノ] - カルボニル] - プロピル} - カルバメート、
 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル
) - エタノン O - (フェニルメチル) - オキシム、
 1 - (2 - メチル - 1 - ナフタレニル) - 1H - ピロール - 2, 5 - ジオン、
 1 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 3 - (2 - プロペニル) - 2, 5 - ピロリジンジオ
 ン、
 1 - [(ジヨードメチル) - スルホニル] - 4 - メチル - ベンゼン、
 1 - [[2 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル] - メチ
 ル] - 1H - イミダゾール、
 50

1 - [[2 - (4 - クロロフェニル) - 3 - フェニルオキシラニル] - メチル] - 1 H -
 1 , 2 , 4 - トリアゾール、
 1 - [1 - [2 - [(2 , 4 - ジクロロフェニル) - メトキシ] - フェニル] - エテニル
] - 1 H - イミダゾール、
 1 - メチル - 5 - ノニル - 2 - (フェニルメチル) - 3 - ピロリジノール、
 2 ' , 6 ' - ジブロモ - 2 - メチル - 4 ' - トリフルオロメトキシ - 4 ' - トリフルオロ
 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 5 - カルボキシアニド、
 2 , 2 - ジクロロ - N - [1 - (4 - クロロフェニル) - エチル] - 1 - エチル - 3 - メ
 チル - シクロプロパンカルボキシアミド、
 2 , 6 - ジクロロ - 5 - (メチルチオ) - 4 - ピリミジルチオシアナート、
 2 , 6 - ジクロロ - N - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - ベンズアミド、
 2 , 6 - ジクロロ - N - [[4 - (トリフルオロメチル) - フェニル] - メチル] - ベン
 ズアミド、
 2 - (2 , 3 , 3 - トリヨード - 2 - プロペニル) - 2 H - テトラゾール、
 2 - [(1 - メチルエチル) - スルホニル] - 5 - (トリクロロメチル) - 1 , 3 , 4 -
 チアジアゾール、
 2 - [[6 - デオキシ - 4 - O - (4 - O - メチル - - D - グリコピラノシリル) - -
 D - グルコピラノシリル] - アミノ] - 4 - メトキシ - 1 H - ピロロ [2 , 3 - d] ピリミ
 ジン - 5 - カルボニトリル、
 2 - アミノブタン、
 2 - ブロモ - 2 - (ブロモメチル) - ペンタンジニトリル、
 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 - ピリジンカルボキシアミド、
 2 - クロロ - N - (2 , 6 - ジメチルフェニル) - N - (イソチオシアナートメチル) -
 アセトアミド、
 2 - フェニルフェノール (O P P) 、
 3 , 4 - ジクロロ - 1 - [4 - (ジフルオロメトキシ) - フェニル] - 1 H - ピロール -
 2 , 5 - ジオン、
 3 , 5 - ジクロロ - N - [シアノ [(1 - メチル - 2 - プロピニル) - オキシ] - メチル
] - ベンズアミド、
 3 - (1 , 1 - ジメチルプロピル - 1 - オキソ - 1 H - インデン - 2 - カルボニトリル、
 3 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - エトキシ - 3 - イソオキサゾリジニル] - ピリ
 ジン、
 4 - クロロ - 2 - シアノ - N , N - ジメチル - 5 - (4 - メチルフェニル) - 1 H - イミ
 ダゾール - 1 - スルホニアミド、
 4 - メチル - テトラゾロ [1 , 5 - a] キナゾリン - 5 (4 H) - オン、
 8 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - N - エチル - N - プロピル - 1 , 4 - ジオキサスピロ
 [4 . 5] デカン - 2 - メタナミン、
 8 - ヒドロキシキノリンサルフェート、
 9 H - キサンテン - 2 - [(フェニルアミノ) - カルボニル] - 9 - カルボン酸ヒドラジ
 ド、
 ビス - (1 - メチルエチル) - 3 - メチル - 4 - [(3 - メチルベンゾイル) - オキシ]
 2 , 5 - チオフェンジカルボキシレート、
 シス - 1 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル
) - シクロヘプタノール、
 シス - 4 - [3 - [4 - (1 , 1 - ジメチルプロピル) - フェニル - 2 - メチルプロピル
] - 2 , 6 - ジメチル - モルホリンヒドロクロリド、
 [(4 - クロロフェニル) - アゾ] - シアノ酢酸エチル、
 炭酸水素カリウム、
 メタンテトラチオールナトリウム塩、

10

20

30

40

50

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 - カルボン酸メチル、

N - (2 , 6 - ジメチルフェニル) - N - (5 - イソオキサゾリルカルボニル) - D L - アラニン酸メチル、

N - (クロロアセチル) - N - (2 , 6 - ジメチルフェニル) - D L - アラニン酸メチル、

N - (2 , 3 - ジクロロ - 4 - ヒドロキシフェニル) - 1 - メチル - シクロヘキサンカルボキシアミド、

N - (2 , 6 - ジメチルフェニル) - 2 - メトキシ - N - (テトラヒドロ - 2 - オキソ - 3 - フラニル) - アセトアミド、

N - (2 , 6 - ジメチルフェニル) - 2 - メトキシ - N - (テトラヒドロ - 2 - オキソ - 3 - チエニル) - アセトアミド、

N - (2 - クロロ - 4 - ニトロフェニル) - 4 - メチル - 3 - ニトロ - ベンゼンスルホニアミド、

N - (4 - シクロヘキシルフェニル) - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - 2 - ピリミジンアミン、

N - (4 - ヘキシルフェニル) - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - 2 - ピリミジンアミン、

N - (5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) - 2 - メトキシ - N - (2 - オキソ - 3 - オキサゾリジニル) - アセトアミド、

N - (6 - メトキシ - 3 - ピリジニル) - シクロプロパンカルボキシアミド、

N - [2 , 2 , 2 - トリクロロ - 1 - [(クロロアセチル) - アミノ] - エチル] - ベンズアミド、

N - [3 - クロロ - 4 , 5 - ビス - (2 - プロピニルオキシ) - フェニル] - N' - メトキシ - メタンイミドアミド、

N - ホルミル - N - ヒドロキシ - D L - アラニン - ナトリウム塩、

O , O - ジエチル [2 - (ジプロピルアミノ) - 2 - オキソエチル] - エチルホスホルアミドチオエート、

O - メチル S - フェニル フェニルプロピルホスホルアミドチオエート、

S - メチル 1 , 2 , 3 - ベンゾチアジアゾール - 7 - カルボチオエート、

スピロ [2 H] - 1 - ベンゾピラン - 2 , 1 ' (3 ' H) - イソベンゾフラン] - 3 ' - オン、

殺バクテリア剤：

プロノポル、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、硫酸銅及び他の銅調剤。

殺虫剤 / 殺ダニ剤 / 殺線虫剤：

アバメクチン、アセフェート、アセタミブリド、アクリナツリン、アラニカルブ、アルジカルブ、アルドキシカルブ、アルファ - シペルメツリン、アルファメツリン、アミトラツ、アベルメクチン、A Z 6 0 5 4 1、アザジラクチン、アザメチフォス、アジンフォス A、アジンフォス M、アゾシクロチン、

バシリス・ポピリアエ (*Bacillus popilliae*)、バシリス・スファエリクス (*Bacillus sphaericus*)、バシリス・スブチリス (*Bacillus subtilis*)、バシリス・ツリンギエンシス (*Bacillus thuringiensis*)、バクロウィルス、ベアウベリア・バシアナ (*Beauveria bassiana*)、ベアウベリア・テネラ (*Beauveria tenebrionis*)、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ベンスルタブ、ベンゾキシメート、ベータシフルツリン、ビフェナゼート、ビフェンツリン、ビオエタノメツリン、ビオペルメツリン、B P M C、プロモフォス A、ブフェンカルブ、ブプロフェジン、ブタチオフォス、ブトカルボキシン、ブチルピリダベン、

10

20

30

40

50

カズサフォス、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、カルタブ、クロエトカルブ、クロレトキシフォス、クロルフェナピル、クロルフェンビンフォス、クロルフルアズリン、クロルメフォス、クロルピリフィオス、クロルピリフィオス M、クロバポルツリン、シス-レスメツリン、シスペルメツリン、クロシツリン、クロエトカルブ、クロフェンテジン、シアノフォス、シクロブレン、シクロプロツリン、シフルツリン、シハロツリン、シヘキサチン、シペルメツリン、シロマジン、
デルタメツリン、デメトンM、デメトンS、デメトン-S-メチル、ジアフェンチウロン、ジアジノン、ジクロルボス、ジフルベンズロン、ジメトエート、ジメチルビンフォス、ジオフェノラン、ジスルフォトン、ドクサト-ナトリウム、ドフェナピン、
エフルシラネート、エマメクチン、エムペンツリン、エンドスルファン、エントモプフト
ラ種 (*Entomopththora spp.*)、エスフェンバレート、エチオフェン
カルブ、エチオン、エトプロフォス、エトフェンプロクス、エトキサゾール、エツリムフ
オス、
フェナミフォス、フェナザクイン、フェンブタチン オキシド、フェニトロチオン、フェ
ノチオカルブ、フェノキサクリム、フェノキシカルブ、フェンプロパツリン、フェンピラ
ド、フェンピリツリン、フェンピロキシメート、フェンバレート、フィプロニル、フル
アジナム、フルアズロン、フルプロシツリネット、フルシクロクスロン、フルシツリネ
ト、フルフェノクスロン、フルテンジン、フルバリネット、フォノフォス、フォスマチラ
ン、フォスチアゼート、フブフェンプロクス、フラチオカルブ、
グラニュローシスウィルス、
ハロフェノジド、HCH、ヘプテノフォス、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾクス、ヒド
ロブレン、
イミダクロプリド、イサゾフォス、イソフェンフォス、イソキサチオン、イベルメクチン
、
核多角体病ウィルス、
ラムダ-シハロツリン、ルフェヌロン、
マラチオン、メカルバム、メタルデヒド、メタミドフォス、メタルヒジウム・アニソブリ
アエ (*Metharhizium anisopliae*)、メタルヒジウム・フラボビ
リデ (*Metharhizium flavoviride*)、メチダチオン、メチオカ
ルブ、メトミル、メトキシフェノジド、メトルカルブ、メトキサジアゾン、メビンフォス
、ミルベメクチン、モノクロトフォス、
ナレド、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、
オメトエート、オキサミル、オキシデメトン M、
パエシロミセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*)、パラチオン A、パラチオン M、ペルメツリン、フェントエート、フォレート、
フォサロン、フォスマト、フォスファミドン、フォキシム、ピリミカルブ、ピリミフォス
A、ピリミフォス M、プロフェノフォス、プロメカルブ、プロポクスル、プロチオフ
オス、プロトエート、ピメトロジン、ピラクロフォス、ピレスメツリン、ピレツルム、ピ
リダベン、ピリダチオン、ピリミジフェン、ピリプロキシフェン、
クイナルフォス、リバビリン、
サリチオン、セブフォス、シラフルオフェン、スピノサド、スルフォテブ、スルプロフォ
ス、
タウ-フルバリネット、テブフェノジド、テブフェンピラド、テブピリミフォス、テフル
ベンズロン、テフルツリン、テメフォス、テミビンフォス、テルブフォス、テトラクロル
ビンフォス、テータシペルメツリン、チアメトキサン、チアプロニル、チアトリフィオス、
シュウ酸水素チオシクラン、チオジカルブ、チオファノクス、ツリンギエンシン、トラロ
シツリン、トラロメツリン、トリアラテン、トリアザメート、トリアゾフォス、トリアズ
ロン、トリクロフェニジン、トリクロルフォン、トリフルムロン、トリメタカルブ、
バミドチオン、バニリプロール、ベルチシリウム・レカニイ (*Verticillium lecanii*)、

10

20

30

40

50

Y I 5302、ゼータ - シペルメツリン、ゾラプロフォス、
 (1R - シス) - [5 - (フェニルメチル) - 3 - フラニル] - メチル - 3 - [(ジヒド
 ロ - 2 - オキソ - 3 (2H) - フラニリデン) - メチル] - 2 , 2 - ジメチルシクロプロ
 パンカルボキシレート、

(3 - フェノキシフェニル) - メチル 2 , 2 , 3 , 3 - テトラメチルシクロプロパンカルボキシレート、

1 - [(2 - クロロ - 5 - チアゾリル) メチル] テトラヒドロ - 3 , 5 - ジメチル - N -
 ニトロ - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 (1H) - イミン、

2 - (2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - 4 - [4 - (1 , 1 - ジメチルエチル) フ
 エニル] - 4 , 5 - ジヒドロ - オキサゾール、
 10

2 - (アセチルオキシ) - 3 - ドデシル - 1 , 4 - ナフタレンジオン、

2 - クロロ - N - [[[4 - (1 - フェニルエトキシ) - フェニル] - アミノ] - カルボ
 ニル] - ベンズアミド、

2 - クロロ - N - [[[4 - (2 , 2 - ジクロロ - 1 , 1 - ジフルオロエトキシ) - フェ
 ニル] - アミノ] - カルボニル] - ベンズアミド、

3 - メチルフェニル プロピルカルバメート、

4 - [4 - (4 - エトキシフェニル) - 4 - メチルペンチル] - 1 - フルオロ - 2 - フエ
 ノキシ - ベンゼン、

4 - クロロ - 2 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - 5 - [[2 - (2 , 6 - ジメチル - 4 -
 フェノキシフェノキシ) エチル] チオ] - 3 (2H) - ピリダジノン、
 20

4 - クロロ - 2 - (2 - クロロ - 2 - メチルプロピル) - 5 - [(6 - ヨード - 3 - ピリ
 デニル) メトキシ] - 3 (2H) - ピリダジノン、

4 - クロロ - 5 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジニル) メトキシ] - 2 - (3 , 4 - ジクロ
 ロフェニル) - 3 (2H) - ピリダジノン、

バシリス・ツリンギエンシス株 EG - 2348、

[2 - ベンゾイル - 1 - (1 , 1 - ジメチルエチル) - ヒドラジノ安息香酸、
 ブタン酸2 , 2 - ジメチル - 3 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 2 - オキソ - 1 - オキ
 サスピロ [4 . 5] デセ - 3 - エン - 4 - イル

[3 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジニル) メチル] - 2 - チアゾリジニリデン] - シアナ
 ミド、
 30

ジヒドロ - 2 - (ニトロメチレン) - 2H - 1 , 3 - チアジン - 3 (4H) - カルボキシ
 アルデヒド、

エチル [2 - [[1 , 6 - ジヒドロ - 6 - オキソ - 1 - (フェニルメチル) - 4 - ピリダ
 ニル] オキシ] エチル] - カルバメート、

N - (3 , 4 , 4 - トリフルオロ - 1 - オキソ - 3 - ブテニル) - グリシン、

N - (4 - クロロフェニル) - 3 - [4 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] - 4 , 5 -
 ジヒドロ - 4 - フェニル - 1H - ピラゾール - 1 - カルボキシアミド、

N - [(2 - クロロ - 5 - チアゾリル) メチル] - N' - メチル - N" - ニトロ - グアニ
 ジン、
 40

N - メチル - N" - (1 - メチル - 2 - プロペニル) - 1 , 2 - ヒドラジンジカルボチオ
 アミド、

N - メチル - N' - 2 - プロペニル - 1 , 2 - ヒドラジンジカルボチオアミド、

O , O - ジエチル [2 - (ジプロピルアミノ) - 2 - オキソエチル] - エチルホスホルア
 ミドチオエート。

【0274】

他の既知の活性化合物、例えば除草剤との、あるいは肥料及び成長調節剤との混合物も可
 能である。

【0275】

さらに、本発明に従う式 (I) の化合物は非常に優れた抗真菌活性も有する。それらは、
 特に皮膚生菌類及び酵母、カビ及び2形性菌・カビ (d i p h a s i c f u n g i) に
 50

対して、例えばカンジダ (*Candida*) 種、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 glabrat*a)、エピデルモフィトン (*Epidermophyton*) 種、例えばエピデルモフィトン・フロクスム (*Epidermophyton floccosum*)、アスペルギルス (*Aspergillus*) 種、例えばアスペルギルス・ニゲル (*Aspergillus niger*) 及びアスペルギルス・フミガタス (*Aspergillus fumigatus*)、トリコフィトン (*Trichophyton*) 種、例えばトリコフィトン・メンタグロフィテス (*Trichophyton mentagrophytes*)、ミクロスボロン (*Micrasterias*) 種、例えばミクロスボロン・カニス (*Micrasterias canis*) 及びアウドウイニイ (*Audouinii*) に対して非常に広い抗真菌活性範囲を有する。 10

【0276】

これらの菌・カビのリストは包含され得る真菌範囲を全く制限するものではなく、単に例示のためである。

【0277】

活性化合物はそのまで、それらの調剤の形態で、又はそれらから調製される使用形態、例えば調製済み溶液、懸濁剤、水和性粉剤、塗布剤、可溶性粉剤、微粉剤及び顆粒剤で使用され得る。適用は通常の方法で、例えば散水、スプレー噴霧、噴霧、散布 (broad casting)、微粉剤適用、泡剤適用、ばらまき (spreading) などにより行われる。さらに超低容量法 (ultra-low volume method) により活性化合物を適用するか、又は活性化合物調製物もしくは活性化合物自身を土壤中に注入することができる。植物の種子を処理することもできる。 20

【0278】

本発明に従う活性化合物を殺菌・殺カビ剤として用いる場合、適用の種類に依存して比較的広い範囲内で適用率を変えることができる。植物の一部の処理のためには、活性化合物の適用率は一般に 0.1 ~ 10,000 g / ヘクタール、好ましくは 10 ~ 1000 g / ヘクタールである。種子のドレッシング (dressing) のためには、活性化合物の適用率は一般に種子のキログラム当たり 0.001 ~ 50 g、好ましくは種子のキログラム当たり 0.01 ~ 10 g である。土壤の処理のためには、活性化合物の適用率は一般に 0.1 ~ 10,000 g / ヘクタール、好ましくは 1 ~ 5000 g / ヘクタールである。 30

【0279】

工業材料の保護のために用いられる組成物は一般に 1 ~ 95 %、好ましくは 10 ~ 75 % の量で活性化合物を含む。

【0280】

本発明に従う活性化合物の使用濃度は、抑制されるべき微生物の性質及び発生度ならびに保護されるべき材料の組成に依存する。用いられる最適量は 1 系列の試験により決定され得る。一般に使用濃度は、保護されるべき材料に基づいて 0.001 ~ 5 重量 %、好ましくは 0.05 ~ 1.0 重量 % の範囲内である。

【0281】

材料の保護において本発明に従って用いられるべき活性化合物又は組成物、濃厚液もしくは非常に一般的にはそれらから調製可能な調剤の活性及び活性範囲を、適宜さらに別の抗微生物的に活性な化合物、殺菌・殺カビ剤、殺バクテリア剤、除草剤、殺虫剤あるいは活性範囲を広げるか又は特定の効果、例えば昆虫に対する追加の保護を得るために他の活性化合物を加えることにより向上させることができる。これらの混合物は、本発明に従う化合物より広い活性範囲を有することができる。 40

【0282】

本発明に従う活性化合物の製造及び使用を下記の実施例において示す。

【0283】

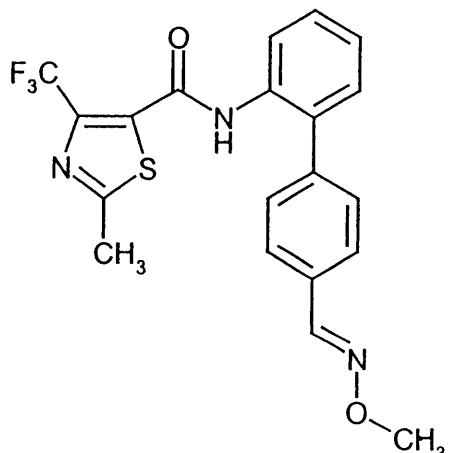
【実施例】

製造実施例

実施例 1

【0284】

【化158】



10

【0285】

方法(a)：

室温で、25m1のトルエン中の0.59g(0.0026モル)の2-(4-メトキシイミノメチル-フェニル)-アニリンの溶液を0.26g(0.0026モル)のトリエチルアミンで処理する。室温で、5m1のトルエン中の0.6g(0.0026モル)の2-メチル-4-トリフルオロメチルチアゾール-5-カルボニルクロリドの溶液をこの混合物中に攪拌しながら入れる。添加が完了した後、反応混合物を50℃に加熱し、この温度で2時間攪拌する。仕上げのために、反応混合物を室温に冷却し、水と混合する。有機相を分離し、硫酸ナトリウム上で乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮する。残る残留物をシリカゲル上で移動相シクロヘキサン：酢酸エチル=3:1を用いてクロマトグラフィーにかける。溶離物を濃縮し、0.81g(理論値の74%)の2'-(4-メトキシイミノメチル-フェニル)-2-メチル-4-トリフルオロメチルチアゾール-5-カルボキシアニリドを、融点が122~123℃の固体として得る。

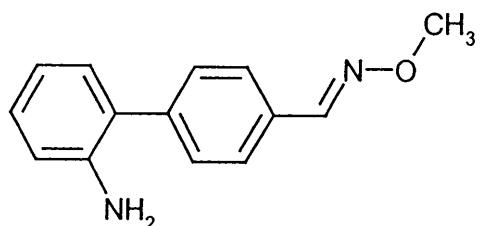
20

出発材料の製造

30

【0286】

【化159】



40

【0287】

室温で、2.9g(0.017モル)の2-ブロモアニリン、0.68gのテトラキス-(トリフェニルホスフィン)パラジウム、5.5g(0.031モル)の4-メトキシイミノメチル-フェニル-ボロン酸及び40m1の1,2-ジメトキシエタンの混合物を35m1の水中の8.2g(0.077モル)の炭酸ナトリウムの溶液で処理する。次いで反応混合物を還流温度に加熱し、12時間煮沸する。仕上げのために、混合物を室温に冷却し、ジエチルエーテルで抽出する。有機相を分離し、水と混合する。有機相を再び分離し、硫酸ナトリウム上で乾燥し、最後に減圧下で濃縮する。残る残留物をシリカゲル上で移動相シクロヘキサン：酢酸エチル=3:1を用いてクロマトグラフィーにかける。溶離物を濃縮し、3.8g(2-ブロモアニリンに基づいて理論値の98.8%)の2-(4-

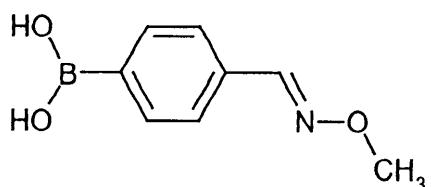
50

-メトキシイミノメチル-フェニル) -アニリンを油の形態で得る。

¹H-NMRスペクトル(DMSO/TMS) : δ = 3.90(3H) ppm.

【0288】

【化160】



10

【0289】

5.0g(0.033モル)の4-ホルミルフェニルボロン酸、3.4g(0.041モル)のメトキシリルアミン塩酸塩、3.4g(0.041モル)の酢酸ナトリウム、40mlのメタノール及び10mlの水の混合物を室温で12時間攪拌する。仕上げのために、反応混合物を水と一緒に攪拌し、得られる沈殿を吸引濾過し、水で洗浄し、減圧下に50度乾燥する。これは5.56g(理論値の93.1%)の4-メトキシイミノメチル-フェニル-ボロン酸を融点が199~200の無色の結晶として与える。

【0290】

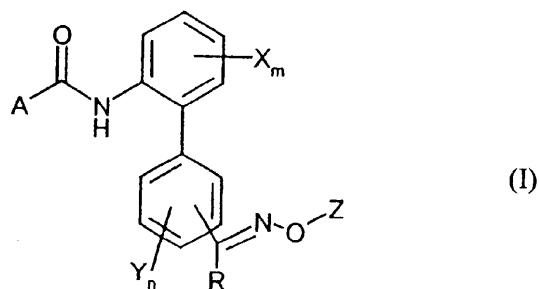
下記の表に挙げる式(I)のビフェニルカルボキシアミドも上記の方法により製造される。

20

【0291】

【表1】

表1



10

実施例番号		物理定数
2		logP 3.42 ^{a)}
3		logP 4.65 ^{a)}
4		融点 107-109°C

20

30

【0292】

【表2】

実施例番号		物理定数
5		logP 4.23 ^{a)} 10
6		融点 129-131°C
7		融点 25-128°C 20
8		融点 110-112°C 30
9		融点 118-120°C

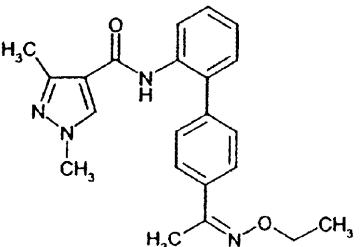
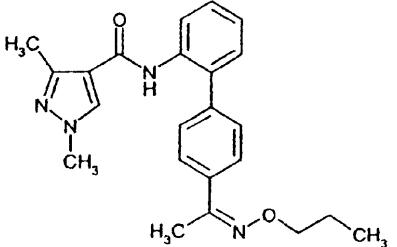
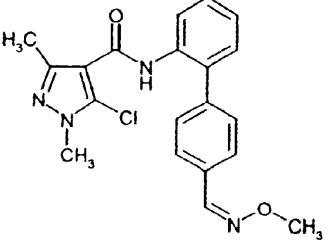
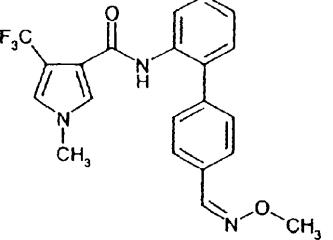
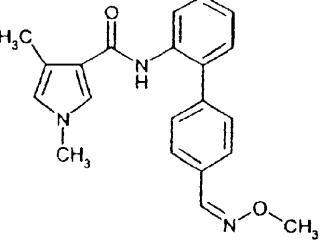
【 0 2 9 3 】

【表3】

実施例番号		物理定数
10		融点 158-160°C 10
11		融点 127-129°C
12		融点 146°C 20
13		融点 137-139°C 30
14		融点 152-153°C 40

【 0 2 9 4 】

【表4】

実施例番号		物理定数
15		10
16		.
17		logP 3.24 ^{a)} 20
18		融点 141-143°C 30
19		logP 5.10 ^{a)}

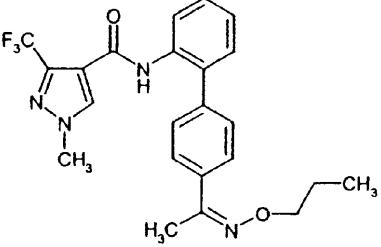
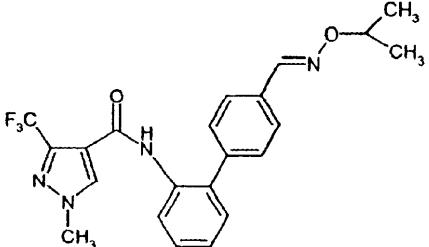
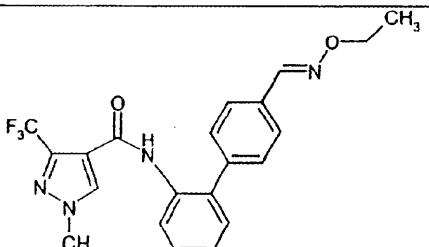
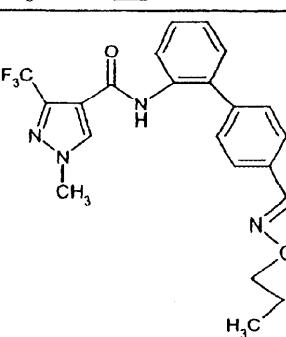
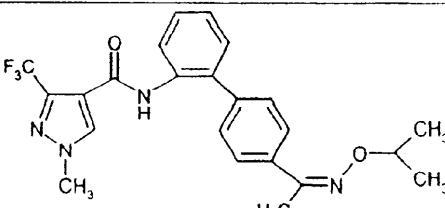
【0295】

【表5】

実施例番号		物理定数
20		融点 116-119°C 10
21		融点 144-147°C
22		logP 4.26 ^{a)} 20
23		logP 4.26 ^{a)} 30
24		融点 160-162°C 40

【0296】

【表6】

実施例番号		物理定数
25		融点 148-150°C 10
26		融点 126-128°C
27		融点 170-172°C 20
28		logP 3.86 ^{a)} 30
29		融点 164-166°C

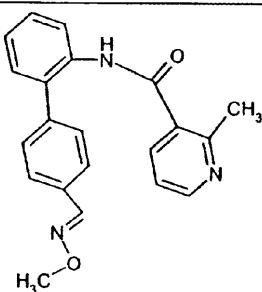
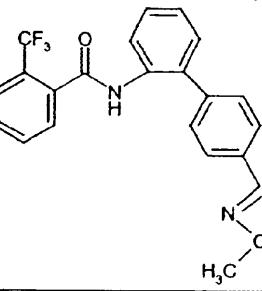
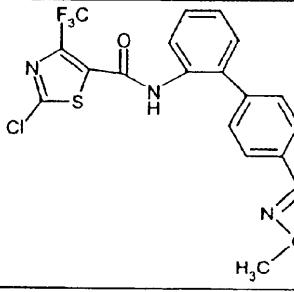
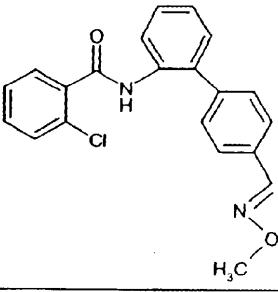
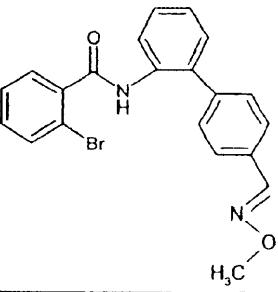
【0297】

【表7】

実施例番号		物理定数
30		$\log P\ 2.78^a)$
31		融点 89-91°C
32		$\log P\ 3.84^a)$
33		$\log P\ 4.12^a)$
34		$\log P\ 4.73^a)$

【0298】

【表8】

実施例番号		物理定数
35		$\log P\ 2.04^a)$
36		$\log P\ 3.75^a)$
37		$\log P\ 4.08^a)$
38		$\log P\ 3.59^a)$
39		$\log P\ 3.61^a)$

【0299】

【表9】

実施例番号		物理定数
40		$\log P\ 3.56^a)$ 10
41		$\log P\ 3.19^a)$
42		$\log P\ 3.47^a)$ 20
43		$\log P\ 3.47^a)$
44		$\log P\ 3.76^a)$ 30
45		$\log P\ 3.73^a)$ 40

【0300】

【表10】

実施例番号		物理定数
46		$\log P 3.73^a)$
47		$\log P 3.86^a)$
48		$\log P 3.84^a)$
49		$\log P 3.54^a)$
50		$\log P 3.36^a)$

【0301】
【表11】

実施例番号		物理定数
51		$\log P\ 3.78^a)$ 10
52		$\log P\ 3.25^a)$
53		$\log P\ 3.75^a)$ 20
54		$\log P\ 3.20^a)$ 30
55		$\log P\ 3.20^a)$

40

【0302】
【表12】

実施例番号		物理定数
56		$\log P\ 4.39^a)$ 10
57		$\log P\ 4.39^a)$
58		$\log P\ 3.37^a)$ 20
59		$\log P\ 3.64^a)$
60		$\log P\ 3.26^a)$ 30
61		$\log P\ 3.26^a)$ 40

【0303】

【表13】

実施例番号		物理定数
62		$\log P\ 3.99^a)$
63		$\log P\ 4.02^a)$
64		$\log P\ 3.94^a)$
65		$\log P\ 3.97^a)$
66		$\log P\ 3.82^a)$

【0304】

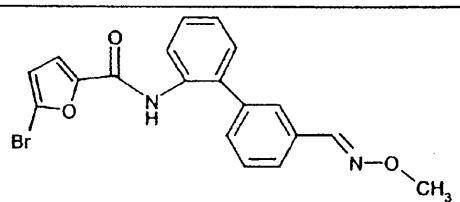
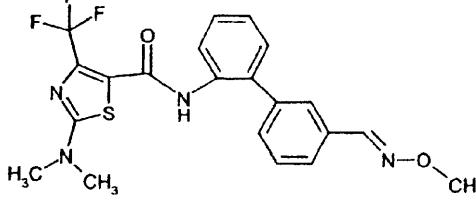
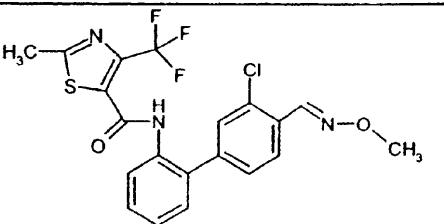
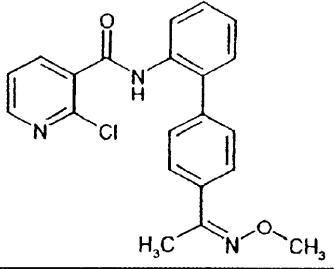
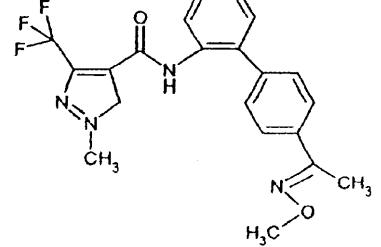
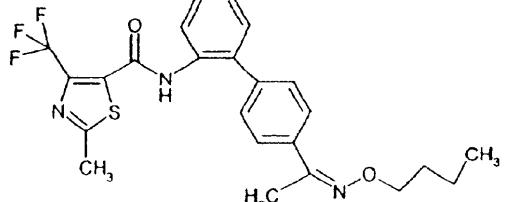
【表14】

40

実施例番号		物理定数
67		$\log P\ 3.75^a)$
68		$\log P\ 3.75^a)$
69		$\log P\ 4.40^a)$
70		$\log P\ 4.45^a)$
71		$\log P\ 3.78^a)$

【0305】
【表15】

40

実施例番号		物理定数
72		$\log P\ 3.80^a)$
73		$\log P\ 4.00^a)$
74		$\log P\ 3.95^a)$
75		融点 129-131°C
76		融点 157-158°C
77		$\log P\ 4.77^a)$

【0306】
【表16】

10

20

30

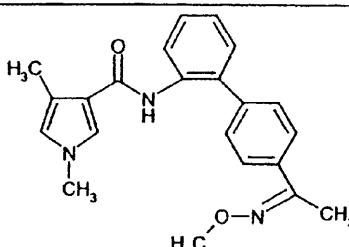
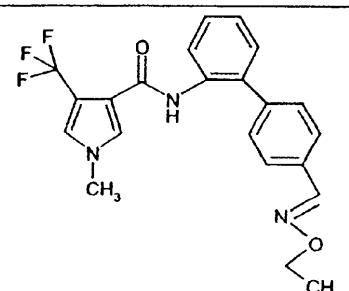
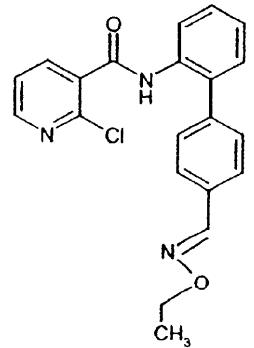
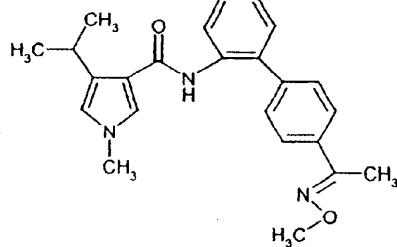
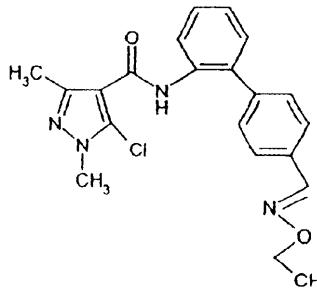
40

実施例番号		物理定数
78		
79		融点 107-109°C 10
80		融点 168-171°C 20
81		融点 148-150°C
82		融点 118°C 30

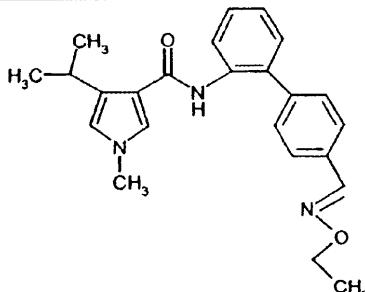
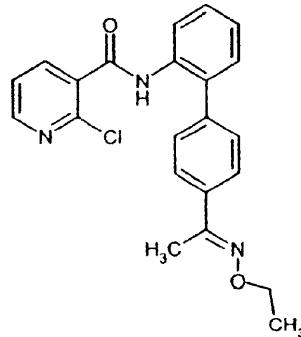
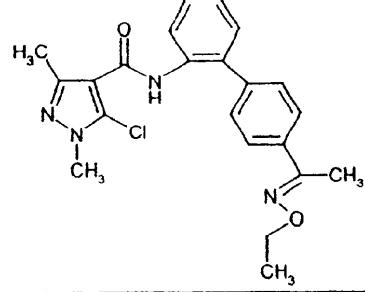
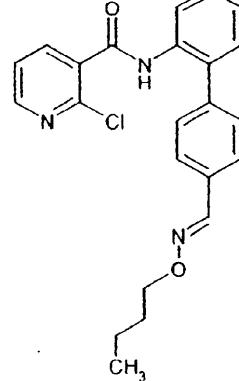
【0307】

【表17】

40

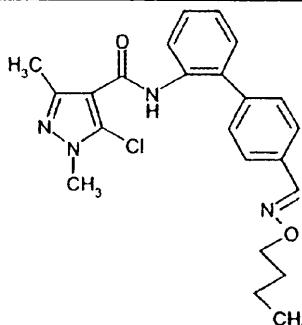
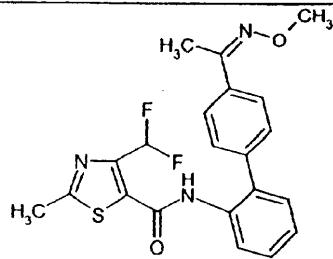
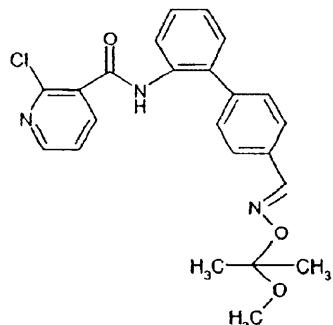
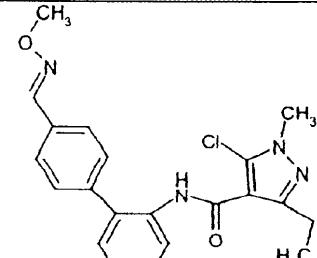
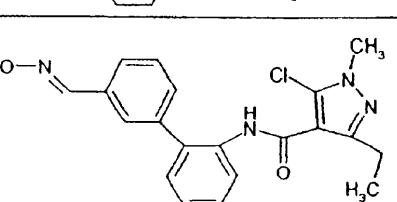
実施例番号		物理定数
83		融点 119-121°C
84		融点 160-162°C
85		
86		融点 115-117°C
87		融点 98°C

【0308】
【表18】

実施例番号	物 理 定 数
88	 <p>融点 108-110°C</p> <p>10</p>
89	 <p>融点 119-121°C</p> <p>20</p>
90	 <p>融点 80-82°C</p>
91	 <p>融点 68-70°C</p> <p>30</p>

【 0 3 0 9 】

【表 1 9 】

実施例番号		物理定数
92		融点 55-57°C 10
93		融点 110-112°C
94		20
95		$\log P$ 3.68 ^{a)} 30
96		$\log P$ 3.72 ^{a)} 40

【0310】
【表20】

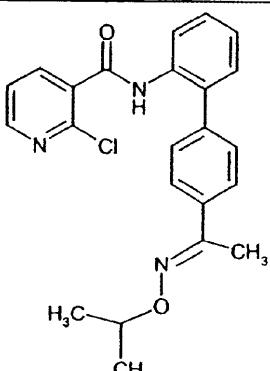
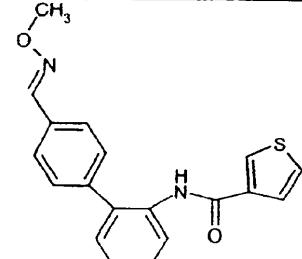
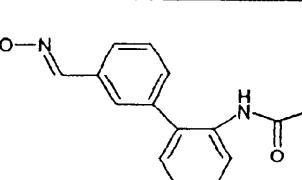
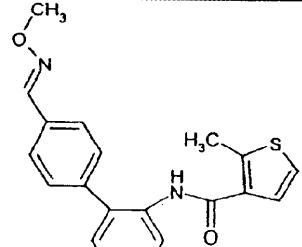
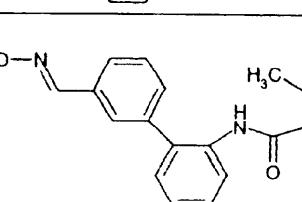
実施例番号		物理定数
97		$\log P\ 3.76^a)$
98		$\log P\ 3.81^a)$
99		$\log P\ 4.67^a)$
100		$\log P\ 4.72^a)$
101		$\log P\ 3.26^a)$
102		$\log P\ 3.26^a)$

【0 3 1 1】
【表 2 1】

実施例番号		物理定数
103		$\log P$ 3.87 ^{a)} 10
104		融点 94-97°C
105		融点 103-105°C 20
106		融点 108-109°C 30

【 0 3 1 2 】

【表 2 2 】

実施例番号		物理定数
107		融点 84-86°C 10
108		$\log P 3.10^a)$ 20
109		
110		$\log P 3.58^a)$ 30
111		$\log P 3.59^a)$

【0313】

【表23】

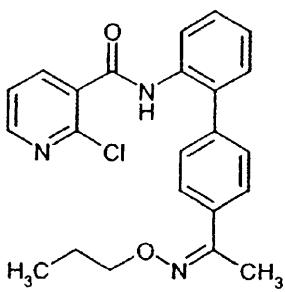
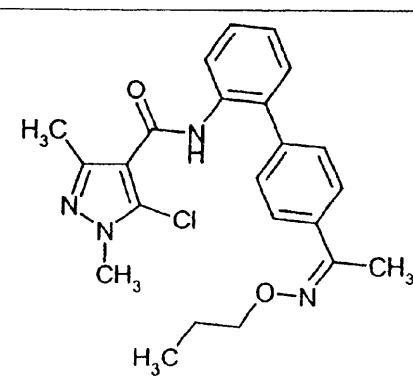
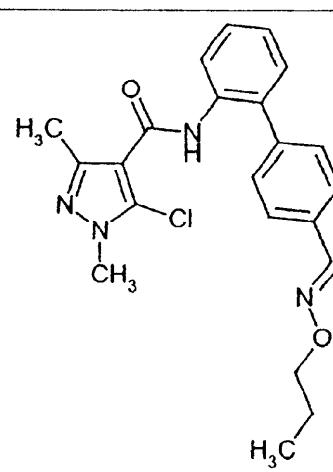
40

実施例番号		物理定数
112		$\log P\ 3.21^a)$ 10
113		$\log P\ 2.43^a)$ 20
114		$\log P\ 3.00^a)$
115		融点157-159°C 30

【0314】

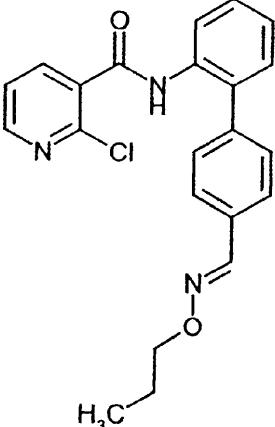
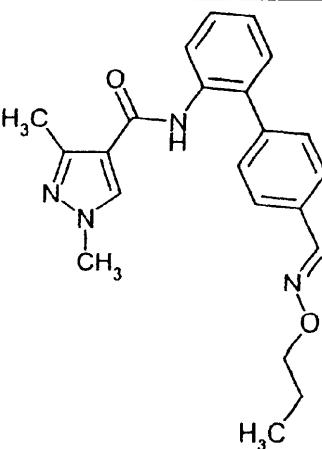
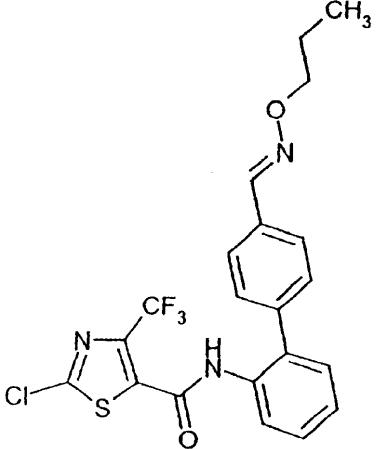
【表24】

40

実施例番号		物理定数
116	 <p>融点 70-72°C</p>	10
117	 <p>融点 75°C</p>	20
118	 <p>$\log P$ 4.22^{a)}</p>	30

【0315】

【表25】

実施例番号	物理定数	
119	 融点 90-92°C	10
120	 融点 141-143°C	20
121	 融点 82-84°C	30 40

【 0 3 1 6 】

表1に示したlog P値は、EEC Directive 79/831 Annex V. A 8に従い、逆-相カラム(C 18)上のHPLC(高性能液体クロマトグラフィー)により決定された。温度：43。

(a) 酸性範囲内における決定のための移動相：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%アセトニトリルまでの線状勾配 - 表1中の対応する測定結果を^{a)}と記す。

(b) 中性範囲内における決定のための移動相：0.01モルリン酸塩緩衝水溶液、アセトニトリル；10%アセトニトリルから90%アセトニトリルまでの線状勾配 - 表1中の対応する測定結果を^{b)}と記す。

トニトリル；10%アセトニトリルから90%アセトニトリルまでの線状勾配 - 表1中の対応する測定結果を^{b)}と記す。

【0317】

既知のlog P値を有する非分枝鎖状アルカン-2-オン（3～16個の炭素原子を有する）を用いてキャリブレーションを行った（2個の連続するアルカノンの間の直線状内挿を用いる保持時間によるlog P値の決定）。

【0318】

ラムダマックス値は、200nm～400nmのUVスペクトルを用い、クロマトグラフィー信号の極大において決定された。

使用実施例

10

実施例A

ポドスファエラ試験（リンゴ）/保護的

溶媒：24.5重量部のアセトン

24.5重量部のジメチルアセトアミド

乳化剤：1.0重量部のアルキル-アリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適した調製物を作るために、1重量部の活性化合物を上記の量の溶媒及び乳化剤と混合し、水を用いて濃厚液を所望の濃度に希釈する。

【0319】

保護活性に関して調べるために、若い植物に、記載する適用率で活性化合物の調製物をスプレー噴霧する。スプレーコーティングが乾燥した後、植物にリンゴベト病の病原体であるポドスファエラ・ロイコトリチャ（*Podosphaera leucotricha*）の水性胞子懸濁液を接種する。次いで植物を約23及び約70%の相対大気湿度において温室内に置く。

20

【0320】

接種から10日後に評価を行う。0%は標準の有効性に相当する有効性を意味し、100%の有効性は感染が観察されないことを意味する。

【0321】

この試験で、例えば以下の製造実施例の本発明に従う化合物は、先行技術の活性より優れた活性を示す：

【0322】

30

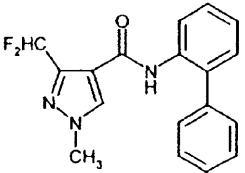
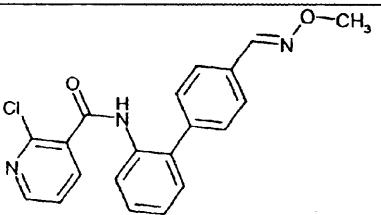
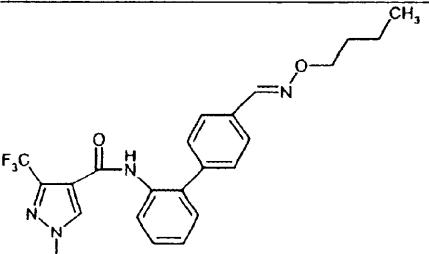
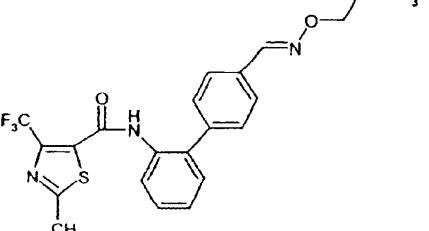
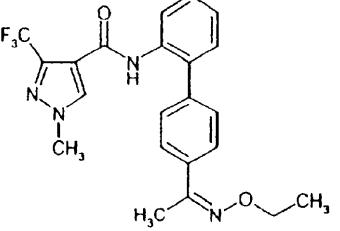
【表26】

表A：ホドスファエラ試験(リンゴ)/保護的

活性化合物		g/ヘクタール における 活性化合物の 適用率	%有効性	
(I-1)		100	100	10
(I-3)		100	100	
(I-4)		100	95	20
(I-5)		100	100	30
(I-10)		100	88	40

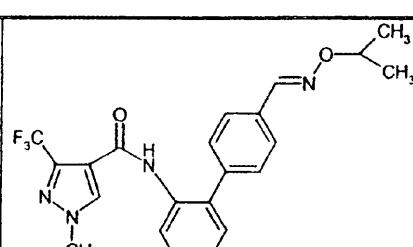
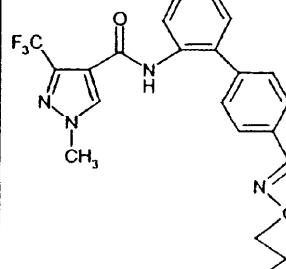
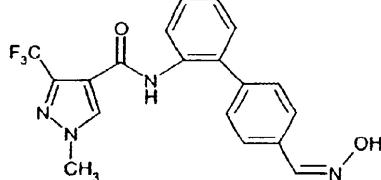
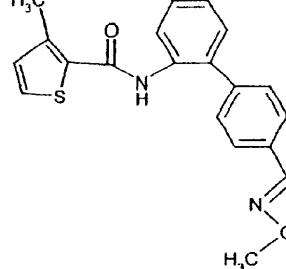
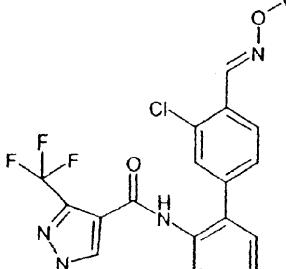
【0 3 2 3】

【表27】

活性化合物		g/ヘクタール における 活性化合物の 適用率	%有効性
(I-11)		100	93
(I-20)		100	100
(I-22)		100	100
(I-23)		100	100
(I-24)		100	75

【 0 3 2 4 】

【表 28】

活性化合物		g/ヘクタール における 活性化合物の 適用率	%有効性
(I-26)		100	100
(I-28)		100	99
(I-41)		100	98
(I-47)		100	100
(I-49)		100	100

【0325】

【表29】

	活性化合物	g/ヘクタール における 活性化合物の 適用率	%有効性	
(I-50)		100	93	10
(I-51)		100	100	20
(I-52)		100	77	

【0326】

実施例B

スファエロテカ試験(キュウリ)/保護的

溶媒: 24.5重量部のアセトン

24.5重量部のジメチルアセトアミド

乳化剤: 1.0重量部のアルキル-アリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適した調製物を作るために、1重量部の活性化合物を上記の量の溶媒及び乳化剤と混合し、水を用いて濃厚液を所望の濃度に希釈する。

【0327】

保護活性に関して調べるために、若い植物に、記載する適用率で活性化合物の調製物をスプレー噴霧する。スプレーコーティングが乾燥した後、植物にスファエロテカ・フリギニア(*Sphaerotilotheca fuliginea*)の水性胞子懸濁液を接種する。次いで植物を約23及び約70%の相対大気湿度において温室内に置く。

【0328】

接種から10日後に評価を行う。0%は標準の有効性に相当する有効性を意味し、100%の有効性は感染が観察されないことを意味する。

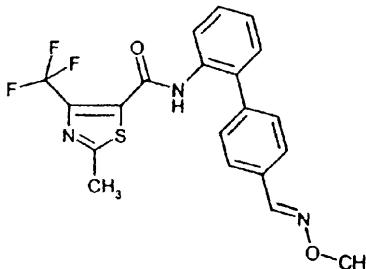
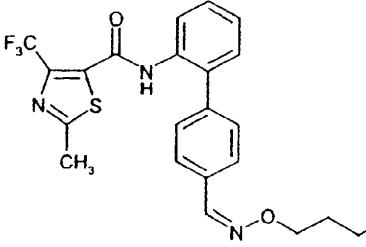
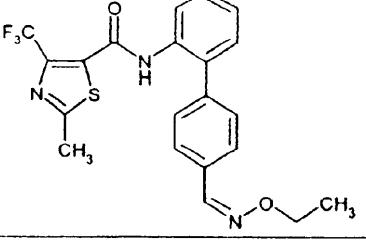
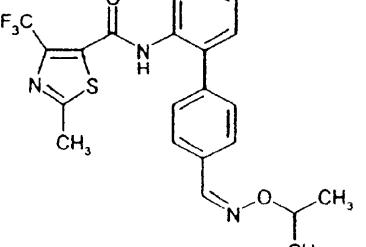
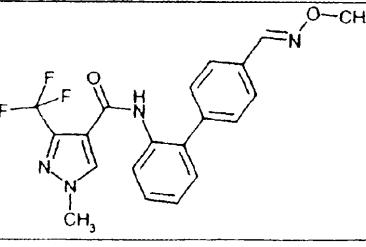
【0329】

この試験で、例えば以下の製造実施例の本発明に従う化合物は、先行技術の活性より優れた活性を示す:

【0330】

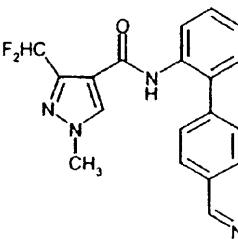
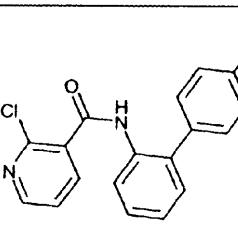
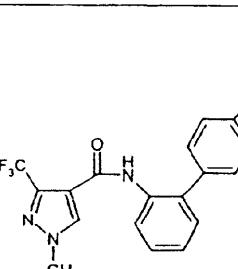
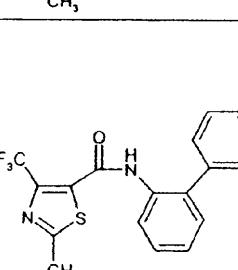
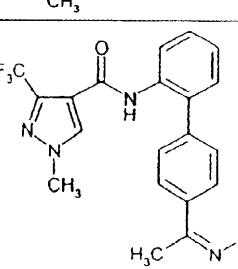
【表30】

表B：スファエロカ試験(キュウリ)/保護的

活性化合物		g/ヘクタール における 活性化合物の 適用率	%有効性	
(I-1)		100	100	10
(I-3)		100	100	20
(I-4)		100	100	
(I-5)		100	100	30
(I-10)		100	88	40

【0331】

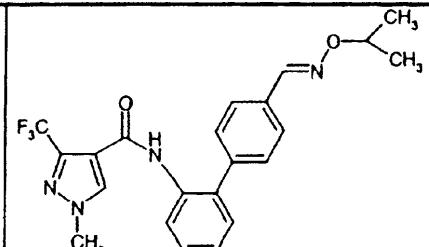
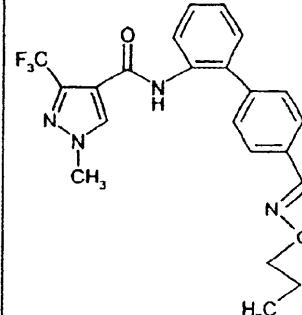
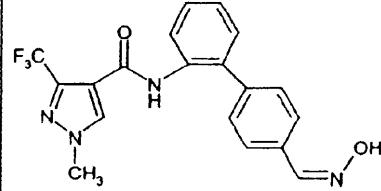
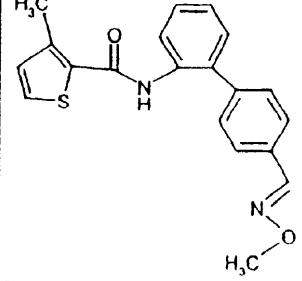
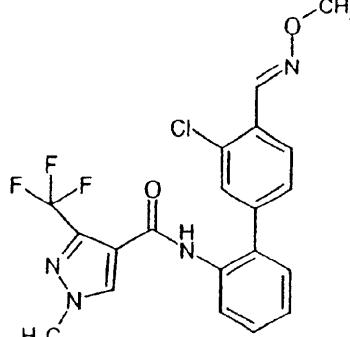
【表31】

活性化合物		g/ヘクタール における 活性化合物の 適用率	%有効性
(I-11)		100	95
(I-20)		100	100
(I-22)		100	100
(I-23)		100	100
(I-24)		100	92

【0 3 3 2】

【表32】

40

活性化合物		g/ヘクタール における 活性化合物の 適用率	%有効性
(I-26)		100	100
(I-28)		100	100
(I-41)		100	72
(I-47)		100	100
(I-49)		100	100

【0 3 3 3】

【表33】

活性化合物		g/ヘクタール における 活性化合物の 適用率	%有効性	
(I-50)		100	97	10
(I-51)		100	100	20
(I-52)		100	97	30

【0334】

実施例C

ベンチュリア試験（リンゴ）／保護的

溶媒：24.5重量部のアセトン

24.5重量部のジメチルアセトアミド

乳化剤：1.0重量部のアルキル-アリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適した調製物を作るために、1重量部の活性化合物を上記の量の溶媒及び乳化剤と混合し、水を用いて濃厚液を所望の濃度に希釈する。

【0335】

保護活性に関して調べるために、若い植物に、記載する適用率で活性化合物の調製物をスプレー噴霧する。スプレーコーティングが乾燥した後、植物にリンゴ黒星病の病原体であるベンチュリア・イナエクアリス (*Venturia inaequalis*) の水性分生子懸濁液を接種し、次いで約20及び100%相対大気湿度においてインキュベーション室内に1日留める。

【0336】

次いで植物を約21及び約90%の相対大気湿度において温室内に置く。

【0337】

接種から12日後に評価を行う。0%は標準の有効性に相当する有効性を意味し、100%の有効性は感染が観察されないことを意味する。

【0338】

この試験で、例えば以下の製造実施例の本発明に従う化合物は、先行技術の活性より優れた活性を示す：

【0339】

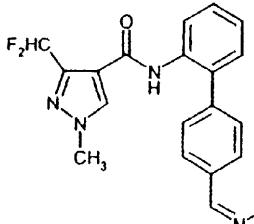
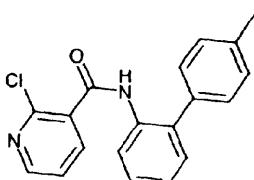
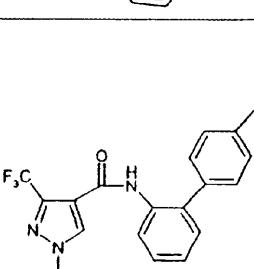
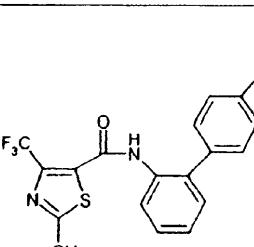
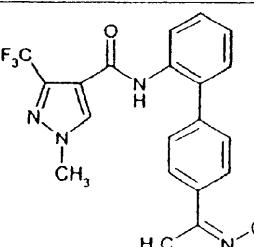
【表34】

表C：ヘンチュリア試験(リコ)/保護的

	活性化合物	g/ヘクタール における 活性化合物の 適用率	%有効性	
(I-1)		100	100	10
(I-3)		100	100	20
(I-4)		100	100	30
(I-5)		100	100	40
(I-10)		100	88	

【0340】

【表35】

活性化合物		g/ヘクタール における 活性化合物の 適用率	%有効性
(I-11)		100	100
(I-20)		100	100
(I-22)		100	100
(I-23)		100	100
(I-24)		100	100

【0 3 4 1】

【表 3 6】

10

20

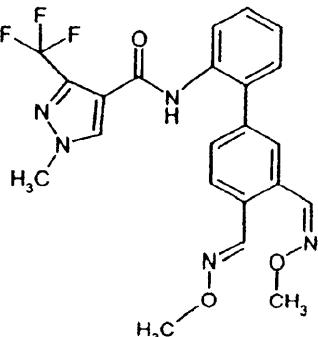
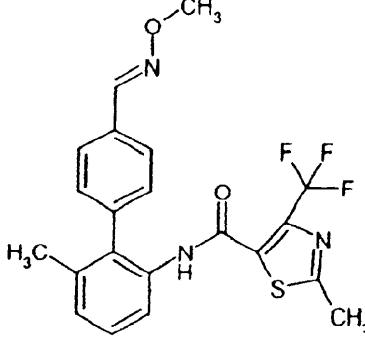
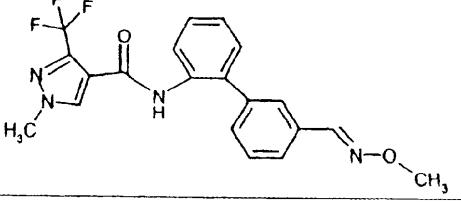
30

40

活性化合物		g/ヘクタール における 活性化合物の 適用率	%有効性	
(I-26)		100	100	10
(I-28)		100	100	20
(I-41)		100	100	
(I-47)		100	100	30
(I-49)		100	100	40

【0 3 4 2】

【表37】

	活性化合物	g/ヘクタール における 活性化合物の 適用率	%有効性	
(I-50)		100	100	10
(I-51)		100	100	20
(I-52)		100	100	30

【0343】

実施例D

プクシニア試験（小麦）／保護的

溶媒：25重量部のN,N-ジメチルアセトアミド

乳化剤：0.6重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適した調製物を作るために、1重量部の活性化合物を上記の量の溶媒及び乳化剤と混合し、水を用いて濃厚液を所望の濃度に希釈する。

【0344】

保護活性に関して調べるために、若い植物に、記載する適用率で活性化合物の調製物をスプレー噴霧する。スプレーコーティングが乾燥した後、植物にプクシニア・レコンジタ（*Puccinia recondita*）の分生子懸濁液を接種する。植物を20及び100%相対大気湿度においてインキュベーション室内に48時間留める。

【0345】

次いで植物を約20の温度及び80%の相対大気湿度において温室内に置き、サビ胞子の発現を促進する。

【0346】

接種から10日後に評価を行う。0%は標準の有効性に相当する有効性を意味し、100%の有効性は感染が観察されないことを意味する。

【0347】

この試験で、例えば以下の製造実施例の本発明に従う化合物は、先行技術の活性より優れた活性を示す：

【0348】

【表38】

表D：ブクシニア試験(小麦)/保護的

活性化合物		g/ヘクタール における 活性化合物の 適用率	%有効性	
(I-1)		250	100	10
(I-3)		250	100	20
(I-10)		250	100	30
(I-20)		250	100	40

【0349】

【表39】

活性化合物		g/ヘクタール における 活性化合物の 適用率	%有効性
(I-49)		250	100
(I-51)		250	100

【0350】

実施例E

アルテルナリア試験（トマト）／保護的

溶媒：49重量部のN,N-ジメチルホルムアミド

乳化剤：1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適した調製物を作るために、1重量部の活性化合物を上記の量の溶媒及び乳化剤と混合し、水を用いて濃厚液を所望の濃度に希釈する。

【0351】

保護活性に関して調べるために、若いトマトの木に、記載する適用率で活性化合物の調製物をスプレー噴霧する。処理から1日後、植物にアルテルナリア・ソラニ (*Alternaria solani*) の胞子懸濁液を接種し、次いで100%相対湿度及び20℃に24時間留める。次いで植物を96%相対大気湿度及び20℃の温度に留める。

【0352】

接種から7日後に評価を行う。0%は標準の有効性に相当する有効性を意味し、100%の有効性は感染が観察されないことを意味する。

【0353】

この試験で、例えば以下の製造実施例の本発明に従う化合物は、先行技術の活性より優れた活性を示す：

【0354】

【表40】

10

20

30

40

表E：アルテルナリア試験(トマト)/保護的

活性化合物		g/ヘクタール における 活性化合物の 適用率	%有効性	
(I-1)		750	100	10
(I-2)		750	100	20
(I-6)		750	90	
(I-11)		750	95	30

【0355】

40

実施例 F

担子菌類の巨大コロニー上における阻害試験

グロエオフィルム・ツラベウム (*Gloeophyllum trabeum*)、コニオフォラ・プテアナ (*Coniophora puteana*)、ポリア・プラセンタ (*Poria placenta*)、レンチヌス・チグリヌス (*Lentinus tigrinus*) 及びコリオルス・ベルシコロル (*Coriolus versicolor*) のコロニーから菌糸体の切片を取り出し、麦芽抽出物ペプトンを含有する寒天培地上で 26 においてインキュベーションした。活性 - 化合物 - 含有培地上における菌糸の成長の阻害を活性化合物が加えられていない培地上の縦成長と比較し、パーセント阻害として評価した。

50

【0356】

この試験で、例えば以下の製造実施例の本発明に従う化合物は、優れた活性を示す：

【0357】

【表41】

表F：担子菌類の巨大コロニー上における阻害試験

活性化合物		ppmにおける活性化合物の適用率	%有効性	
(I-1)		6	100	10
(I-10)		6	100	20
(I-11)		6	100	30
(I-12)		6	100	40

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I
A 0 1 N	43/36	(2006.01) A 0 1 N 43/36 A
A 0 1 N	43/40	(2006.01) A 0 1 N 43/40 1 0 1 A
A 0 1 N	43/56	(2006.01) A 0 1 N 43/40 1 0 1 E
A 0 1 N	43/76	(2006.01) A 0 1 N 43/56 C
A 0 1 N	43/78	(2006.01) A 0 1 N 43/76
A 0 1 P	3/00	(2006.01) A 0 1 N 43/78 A
A 6 1 K	31/167	(2006.01) A 0 1 N 43/78 B
A 6 1 K	31/341	(2006.01) A 0 1 N 43/78 D
A 6 1 K	31/381	(2006.01) A 0 1 P 3/00
A 6 1 K	31/39	(2006.01) A 6 1 K 31/167
A 6 1 K	31/40	(2006.01) A 6 1 K 31/341
A 6 1 K	31/415	(2006.01) A 6 1 K 31/381
A 6 1 K	31/421	(2006.01) A 6 1 K 31/39
A 6 1 K	31/426	(2006.01) A 6 1 K 31/40
A 6 1 K	31/44	(2006.01) A 6 1 K 31/415
A 6 1 P	31/10	(2006.01) A 6 1 K 31/421
C 0 7 C	221/00	(2006.01) A 6 1 K 31/426
C 0 7 C	223/06	(2006.01) A 6 1 K 31/44
C 0 7 C	225/22	(2006.01) A 6 1 P 31/10
C 0 7 C	231/02	(2006.01) C 0 7 C 221/00
C 0 7 C	233/76	(2006.01) C 0 7 C 223/06
C 0 7 C	249/12	(2006.01) C 0 7 C 225/22
C 0 7 D	207/34	(2006.01) C 0 7 C 231/02
C 0 7 D	213/82	(2006.01) C 0 7 C 233/76
C 0 7 D	231/14	(2006.01) C 0 7 C 249/12
C 0 7 D	231/16	(2006.01) C 0 7 D 207/34
C 0 7 D	263/34	(2006.01) C 0 7 D 213/82
C 0 7 D	277/20	(2006.01) C 0 7 D 231/14
C 0 7 D	277/56	(2006.01) C 0 7 D 231/16
C 0 7 D	307/30	(2006.01) C 0 7 D 263/34
C 0 7 D	307/68	(2006.01) C 0 7 D 277/56
C 0 7 D	307/71	(2006.01) C 0 7 D 307/30
C 0 7 D	327/06	(2006.01) C 0 7 D 307/68
C 0 7 D	333/38	(2006.01) C 0 7 D 307/71
C 0 7 F	5/02	(2006.01) C 0 7 D 327/06
C 0 7 B	61/00	(2006.01) C 0 7 D 333/38
		C 0 7 F 5/02 C
		C 0 7 B 61/00 3 0 0

(72)発明者 ドウンケル , ラルフ

ドイツ4 0 7 8 9 モンハイム・クリシャーシュトラーセ2 2

(72)発明者 バヘンドルフ - ノイマン , ウルリケ

ドイツ5 6 5 6 6 ノイビート・オベラーマルケンベーク8 5

(72)発明者 マウラー - マクニク , アストリート

ドイツ4 2 7 9 9 ライヒリンゲン・ノイエンカンパーべーク4 8

(72)発明者 クク , カール - ハインツ

ドイツ4 0 7 6 4 ランゲンエルト・パストル - レー - シュトラーセ3 0 ア-

(72)発明者 ククラー , マルテイン
ドイツ 4 2 7 9 9 ライヒリンゲン・アムクロスター 4 7
(72)発明者 ヤエチユ , トマス
ドイツ 5 0 6 7 0 ケルン・イネレカナルシユトラーセ 2 2 0

審査官 斎藤 貴子

(56)参考文献 特表平 11 - 507009 (JP, A)
特表平 05 - 507686 (JP, A)
特開 2001 - 335550 (JP, A)
特表 2004 - 523467 (JP, A)
米国特許出願公開第 2003 / 0044840 (US, A1)
特開昭 58 - 162549 (JP, A)
英国特許第 01365603 (GB, B)
Journal of Chemical Crystallography, 1994年, Vol.24, No.9, P.621-626

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07C C07D
CAplus(STN)
REGISTRY(STN)