

(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 I

C O 7 C 251/48 (2006.01)

C O 7 C 251/48

C S P

A O 1 N 37/22 (2006.01)

A O 1 N 37/22

I O I

A O 1 N 43/08 (2006.01)

A O 1 N 43/08

B

A O 1 N 43/10 (2006.01)

A O 1 N 43/10

C

A O 1 N 43/32 (2006.01)

A O 1 N 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) 国際出願番号 PCT/EP2001/007981  
 (87) 国際公開番号 W02002/008197  
 (87) 国際公開日 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  
 ンゲゼルシャフト  
 ドイツ40789モンハイム・アルフレー  
 トーノベルーシュトラッセ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ブツペルタル・ダスネ  
 ツケル59  
 (72) 発明者 リーク, ハイコ  
 ドイツ40764ランゲンフェルト・グー  
 トルンシュトラッセ4

最終頁に続く

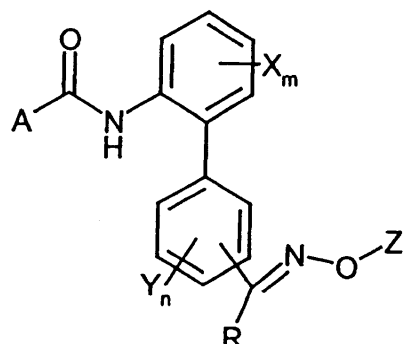
(54) 【発明の名称】 ビフェニルカルボキシアミド類

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 (I)

【化1】



(I),

10

[ 式中、

R は水素、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - 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 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロゲノアルキルを示し、Z は水素、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - 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 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - 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、 $C_1 - C_8$  - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_6$  - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_8$  - アルコキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_6$  - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_8$  - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_6$  - ハロゲノアルキルチオ、 $C_2 - C_8$  - アルケニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_2 - C_8$  - ハロゲノアルケニルオキシ、 $C_3 - C_8$  - アルキニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_3 - C_8$  - ハロゲノアルキニルオキシ、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_1 - C_8$  - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_8$  - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_8$  - アルキルスルホニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_8$  - 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  $C_1 - C_8$  - ハロゲノアルキルスルホニル又は  $C_1 - C_6$  - アルコキシミノ -  $C_1 - C_6$  - アルキルを示し、

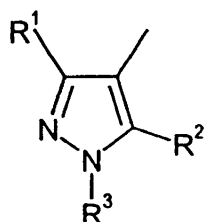
10

$m$  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

)  $R^1$  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、

$R^2$  は水素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又は  $C_1 - C_4$  - アルキルチオを示し、

30

$R^3$  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、

40

$R^2$  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、

50

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、

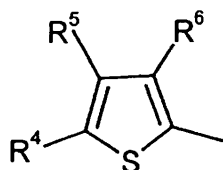
$R^2$ はフッ素を示し、

$R^3$ 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

【化3】



の基を示し、ここで

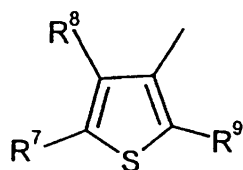
$R^4$ 及び $R^5$ は互いに独立してそれぞれ水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル又は1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルを示し、

$R^6$ 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

Aは式

【化4】



の基を示し、ここで

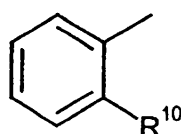
$R^7$ 及び $R^8$ は互いに独立してそれぞれ水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル又は1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルを示し、

$R^9$ は水素、 $C_1 - C_4$ -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】



の基を示し、ここで

$R^{10}$ は水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 $C_1 - C_6$ -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、1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$

10

20

30

40

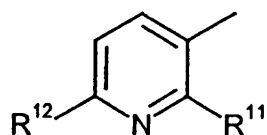
50

- 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  $C_1 - C_4$  - 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

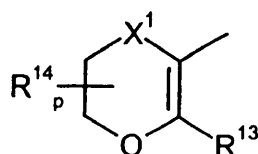
$R^{11}$  はハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 $C_1 - C_4$  - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルチオを示すか、又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルコキシを示し、

$R^{12}$  は水素、ハロゲン、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  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキルスルフィニルを示すか、又は  $C_1 - C_4$  - アルキルスルホニルを示すか、

あるいは

A は式

【化 7】



の基を示し、ここで

$R^{13}$  は  $C_1 - C_4$  - 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、

$R^{14}$  は  $C_1 - C_4$  - アルキルを示し、

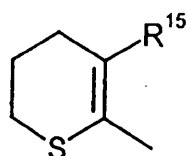
$X^1$  は硫黄原子を示すか、 $SO$ 、 $SO_2$  もしくは  $CH_2$  を示し、

$p$  は 0、1 又は 2 を示すか、

あるいは

A は式

【化 8】



の基を示し、ここで

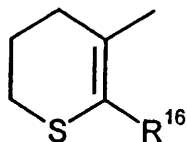
$R^{15}$  は  $C_1 - C_4$  - アルキルを示すか、又は 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

A は式

40

## 【化 9】



の基を示し、ここで

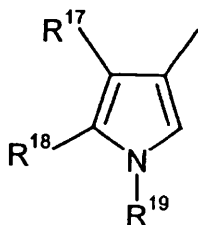
$R^{16}$ は $C_1 - C_4$ -アルキルを示すか、又は1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aは式

10

## 【化 10】



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、

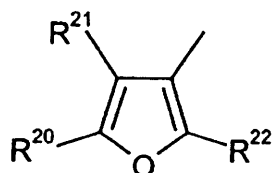
あるいは

Aは式

20

30

## 【化 11】



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、

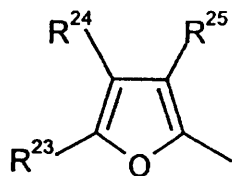
40

$R^{22}$ 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

## 【化 1 2】



の基を示し、ここで

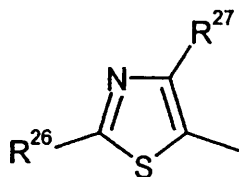
R<sup>23</sup>及びR<sup>24</sup>は互いに独立してそれぞれ水素、ハロゲン、アミノ、ニトロ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルを示すか、又は1～5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキルを示し、

10

R<sup>25</sup>は水素、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-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<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

## 【化 1 3】



20

の基を示し、ここで

R<sup>26</sup>は水素、ハロゲン、アミノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルアミノ、ジ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル)アミノ、シアノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-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<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキルを示し、

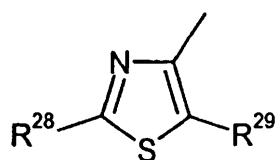
R<sup>27</sup>はハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル又は1～5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aは式

30

## 【化 1 4】



の基を示し、ここで

R<sup>28</sup>は水素、ハロゲン、アミノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルアミノ、ジ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル)アミノ、シアノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-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<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキルを示し、

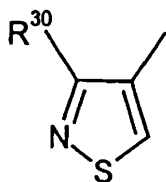
40

R<sup>29</sup>はハロゲン、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

## 【化 15】



の基を示し、ここで

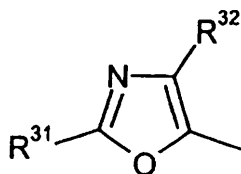
$R^{30}$ はハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル又は1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルを示すか、

10

あるいは

Aは式

## 【化 16】



の基を示し、ここで

20

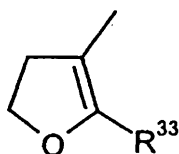
$R^{31}$ は水素又は $C_1 - C_4$ -アルキルを示し、

$R^{32}$ はハロゲン又は $C_1 - C_4$ -アルキルを示すか、

あるいは

Aは式

## 【化 17】



の基を示し、ここで

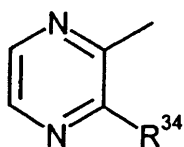
30

$R^{33}$ は $C_1 - C_4$ -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すか、

あるいは

Aは式

## 【化 18】



40

の基を示し、ここで

$R^{34}$ は水素、ハロゲンを示すか、又は $C_1 - C_4$ -アルキルを示す]のビフェニルカルボキサミド類。

## 【請求項 2】

Rが水素、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_3 - C_6$ -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 $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルを示し、

Zが水素、 $C_1 - C_4$ -アルキルあるいは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、

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、 $C_1 - C_6$ -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 $C_1 - C_2$ -ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_6$ -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 $C_1 - C_2$ -ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -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 $C_1 - C_2$ -ハロゲノアルキルチオ、 $C_2 - C_6$ -アルケニルオキシ、1～5個のハロゲン原子を有する $C_2 - C_6$ -ハロゲノアルケニルオキシ、 $C_3 - C_6$ -アルキニルオキシ、1～5個のハロゲン原子を有する $C_3 - C_6$ -ハロゲノアルキニルオキシ、 $C_3 - C_7$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニル、1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_6$ -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 $C_1 - C_6$ -ハロゲノアルキルスルホニルを示すか、又は $C_1 - C_4$ -アルコキシイミノ -  $C_1 - C_4$ -アルキルを示し、

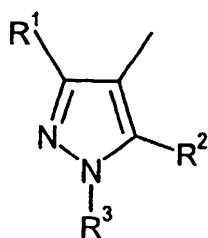
10

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】



20

の基を示し、ここで

） $R^1$ 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 $C_1 - C_2$ -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 $C_1 - C_2$ -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

$R^2$ 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、

$R^3$ 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 $C_1 - C_2$ -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

） $R^1$ 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 $C_1 - C_2$ -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 $C_1 - C_2$ -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

$R^2$ はフッ素を示し、

$R^3$ 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 $C_1 - C_2$ -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

） $R^1$ 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 $C_1 - C_2$ -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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-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、

R<sup>2</sup>はフッ素を示し、

R<sup>3</sup>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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-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

Aが式

【化20】



の基を示し、ここで

R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示し

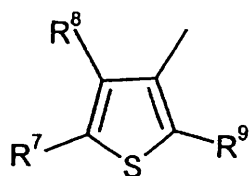
、

R<sup>6</sup>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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルコキシを示すか、

あるいは

Aが式

【化21】



の基を示し、ここで

R<sup>7</sup>及びR<sup>8</sup>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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示し

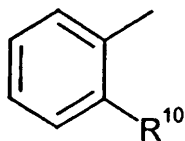
、

R<sup>9</sup>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】



の基を示し、ここで

R<sup>10</sup>は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキ

10

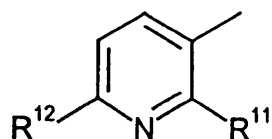
20

30

40

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

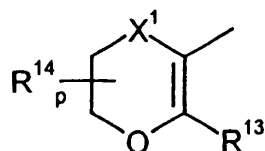
R<sup>11</sup>はフッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、1～5個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルコキシを示し、

R<sup>12</sup>は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-アルキルスルフィニル又はC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-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

R<sup>13</sup>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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示し、

R<sup>14</sup>はメチル又はエチルを示し、

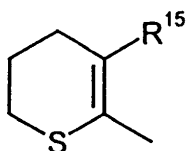
X<sup>1</sup>は硫黄原子を示すか、SO、SO<sub>2</sub>もしくはCH<sub>2</sub>を示し、

pは0、1又は2を示すか、

あるいは

A が式

【化 2 5】



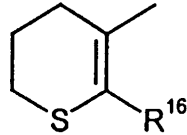
の基を示し、ここで

R<sup>15</sup>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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

A が式

## 【化 2 6】



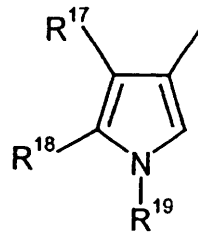
の基を示し、ここで

$R^{16}$ 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 $C_1 - C_2$ -ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aが式

## 【化 2 7】



の基を示し、ここで

$R^{17}$ 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 $C_1 - C_2$ -ハロゲノアルキルを示し、

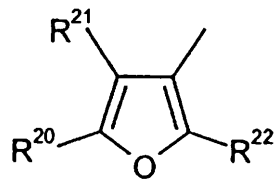
$R^{18}$ は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_2$ -ハロゲノアルキルを示し、

$R^{19}$ 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 $C_1 - C_2$ -ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_2$ -アルコキシ- $C_1 - C_2$ -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 2 8】



の基を示し、ここで

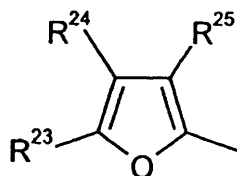
$R^{20}$ 及び $R^{21}$ は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有する $C_1 - C_2$ -ハロゲノアルキルを示し、

$R^{22}$ 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 $C_1 - C_2$ -ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aが式

## 【化 2 9】



の基を示し、ここで

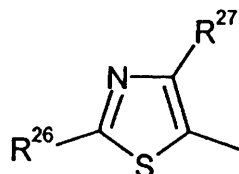
R<sup>23</sup>及びR<sup>24</sup>は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、ニトロ、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示し、

R<sup>25</sup>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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aが式

## 【化 3 0】



の基を示し、ここで

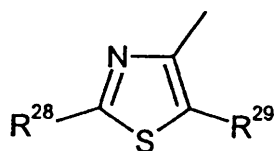
R<sup>26</sup>は水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルアミノ、ジ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル)アミノ、シアノ、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示し、

R<sup>27</sup>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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aが式

## 【化 3 1】



の基を示し、ここで

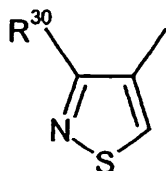
R<sup>28</sup>は水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルアミノ、ジ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル)アミノ、シアノ、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示し、

R<sup>29</sup>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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aが式

## 【化 3 2】



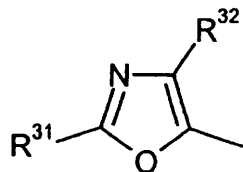
の基を示し、ここで

$R^{30}$ 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 $C_1 - C_2$ -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

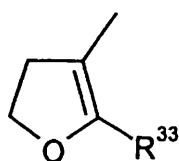
$R^{31}$ は水素、メチル又はエチルを示し、

$R^{32}$ 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34】



20

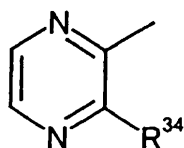
の基を示し、ここで

$R^{33}$ 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 $C_1 - C_2$ -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

$R^{34}$ 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、 $C_1 - C_4$ -アルキルを示し、

Zが水素、 $C_1 - C_4$ -アルキルを示し、

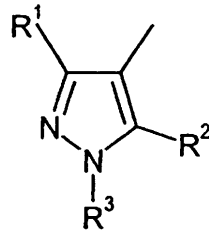
X及びYが互いに独立してそれぞれフッ素、塩素、臭素、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、カルボキシル、メチル、エチル、n-プロピル、イソ-プロピル、n-ブチル、sec-ブチル、i-ブチル、tert-ブチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、アリルオキシ、プロパルギルオキシ、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メトキシイミノメチル、エトキシイミノメチル、メトキシイミノ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、

40

nが0～4の数値を示し、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

50

を示し、  
A が式  
【化 3 6】



10

の基を示し、ここで

）R<sup>1</sup>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、

R<sup>2</sup>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、

R<sup>3</sup>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

）R<sup>1</sup>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、

R<sup>2</sup>はフッ素を示し、

R<sup>3</sup>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

）R<sup>1</sup>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、

R<sup>2</sup>はフッ素を示し、

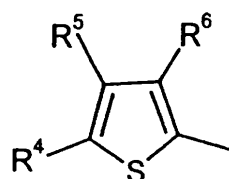
R<sup>3</sup>は水素、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル又はフェニルを示すか、

あるいは

A が式

40

【化 3 7】



の基を示し、ここで

R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>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、

$R^6$ 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

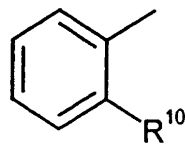
$R^7$ 及び $R^8$ は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示し、

$R^9$ 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

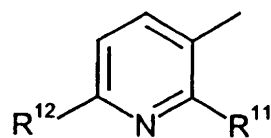
の基を示し、ここで

$R^{10}$ 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

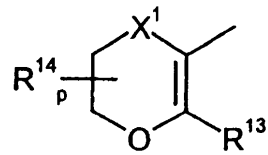
$R^{11}$ はフッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、シアノ、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、トリクロロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ又はトリクロロメトキシを示し、

$R^{12}$ 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

40

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

R<sup>13</sup>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、

R<sup>14</sup>はメチル又はエチルを示し、

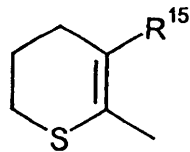
X<sup>1</sup>は硫黄原子を示すか、SO、SO<sub>2</sub>又はCH<sub>2</sub>を示し、

pは0、1又は2を示すか、

あるいは

A が式

【化 4 2】



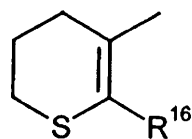
の基を示し、ここで

R<sup>15</sup>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】



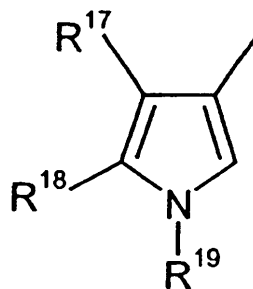
の基を示し、ここで

R<sup>16</sup>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】



の基を示し、ここで

10

20

30

40

50



R<sup>17</sup>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、

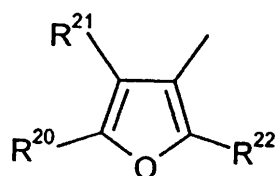
R<sup>18</sup>は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル又はトリクロロメチルを示し、

R<sup>19</sup>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

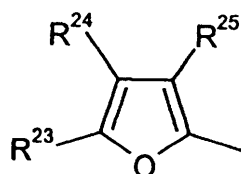
R<sup>20</sup>及びR<sup>21</sup>は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示し、

R<sup>22</sup>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】



の基を示し、ここで

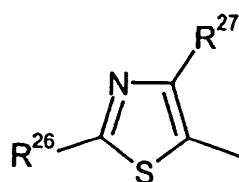
R<sup>23</sup>及びR<sup>24</sup>は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、ニトロ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示し、

R<sup>25</sup>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】



の基を示し、ここで

R<sup>26</sup>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、

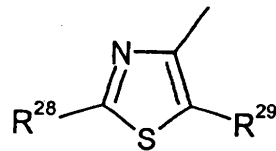
R<sup>27</sup>はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示すか、

30

40

50

あるいは  
A が式  
【化 4 8】

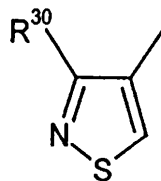


の基を示し、ここで

R<sup>28</sup>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、

R<sup>29</sup>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、

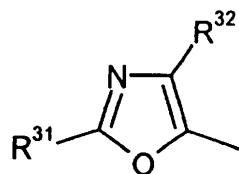
あるいは  
A が式  
【化 4 9】



の基を示し、ここで

R<sup>30</sup>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】

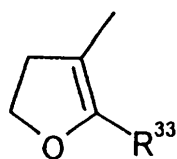


の基を示し、ここで

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か、

あるいは  
A が式  
【化 5 1】



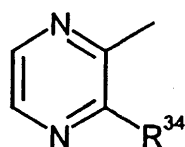
の基を示し、ここで

R<sup>33</sup>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 5 2】



の基を示し、ここで

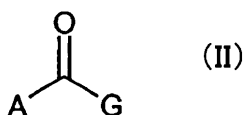
R<sup>34</sup> は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル又はエチルを示す  
請求項 1 に従う式 (I) のビフェニルカルボキシアミド類。

10

【請求項 4】

式 (II)

【化 5 3】



[ 式中、

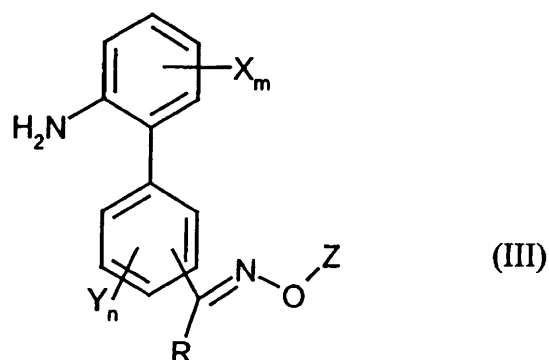
A は請求項 1 で定義したとおりであり、

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

20

のカルボン酸誘導体を式 (III)

【化 5 4】



30

[ 式中、

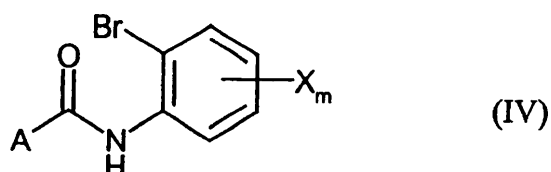
R、Z、X、Y、m 及び n はそれぞれ請求項 1 で定義したとおりである ]

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 5】

式 (IV)

【化 5 5】



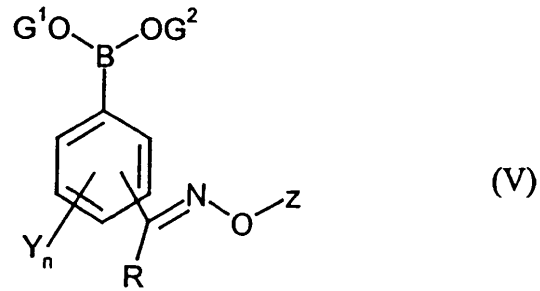
[ 式中、

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)

40

【化 5 6】



[ 式中、

10

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、

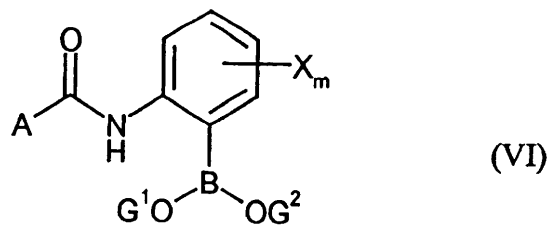
G¹ 及び G² はそれぞれ水素を示すか、又は一緒になってテトラメチルエチレンを示す ]

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 ( V I )

【化 5 7】



20

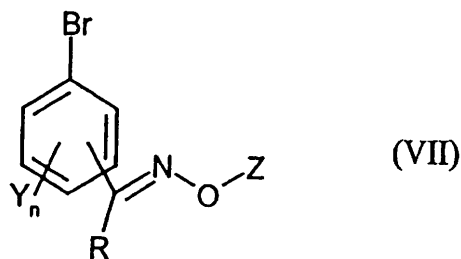
[ 式中、

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 ( V I I )

【化 5 8】



30

[ 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 ]

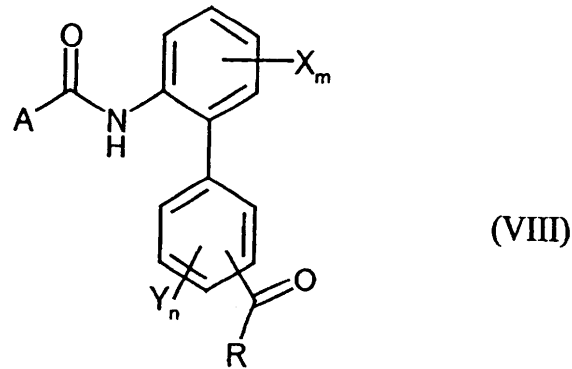
のフェニルオキシム誘導体と、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釈剤の存在下で反応させることを特徴とする請求項 1 に従う式 ( I ) のビフェニルカルボキシアミド類の製造法。

40

【請求項 7】

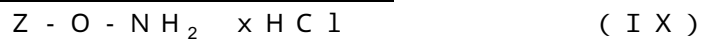
式 ( V I I I )

【化 5 9】



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 (IX)



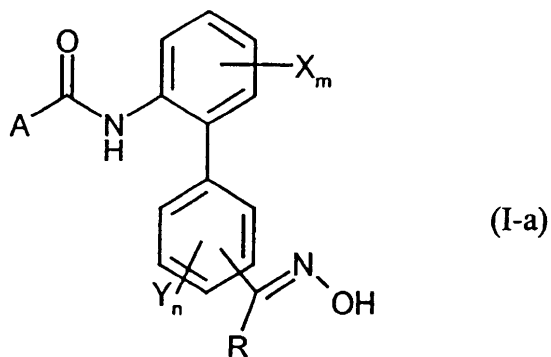
[ 式中、Zはそれぞれ請求項1で定義したとおりである ]  
のアルコキシアミンと、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釈剤の存在下で反応させること  
を特徴とする請求項1に従う式 (I) のビフェニルカルボキシアミド類の製造法。

【請求項8】

式 (I - a)

20

【化 6 0】



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)



[ 式中、  
Z<sup>1</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - 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

Z<sup>1</sup>とEは一緒になって (ジ - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル) サルフェートを示す ]

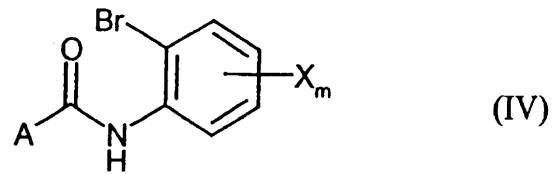
40

の化合物と、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9】

式 (IV)

【化 6 1】



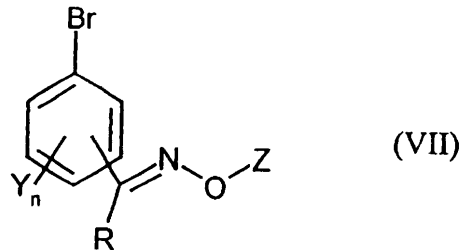
〔式中、

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 I I )

10

【化 6 2】



〔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〕

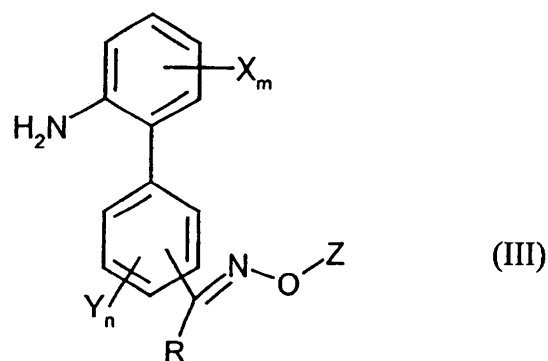
のフェニルオキシム誘導体と、パラジウムもしくは白金触媒の存在下及び 4 , 4 ' , 4 ' , 5 , 5 , 5 ' , 5 ' - オクタメチル - 2 , 2 ' - ビス - 1 , 3 , 2 - ジオキサボロランの存在下に、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釈剤の存在下で反応させることを特徴とする請求項 1 に従う式 ( I ) のビフェニルカルボキシアミド類の製造法。

20

【請求項 1 0】

式 ( I I I )

【化 6 3】



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〕

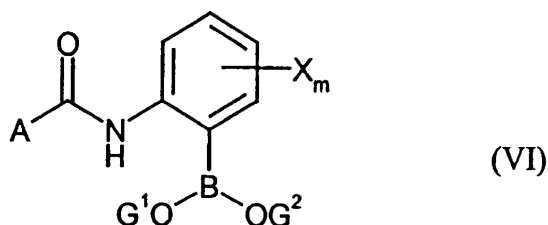
のアニリン誘導体。

40

【請求項 1 1】

式 ( V I )

【化 7 0】



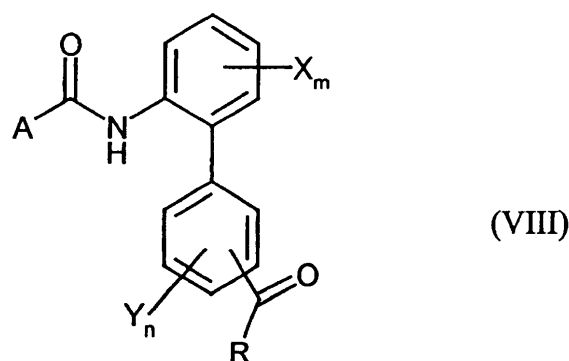
〔式中、  
A、X及びmはそれぞれ請求項1で定義したとおりであり、  
G<sup>1</sup>及びG<sup>2</sup>はそれぞれ水素を示すか、又は一緒になってテトラメチルエチレンを示す〕  
のカルボキシアミド - ボロン酸誘導体。

10

【請求項 1 2】

式 (V I I I)

【化 7 3】



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 1 3】

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 1 4】

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】

多数のカルボキシアニリド類が殺菌・殺力ビ性を有することは既知である (WO 93 / 11117、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。

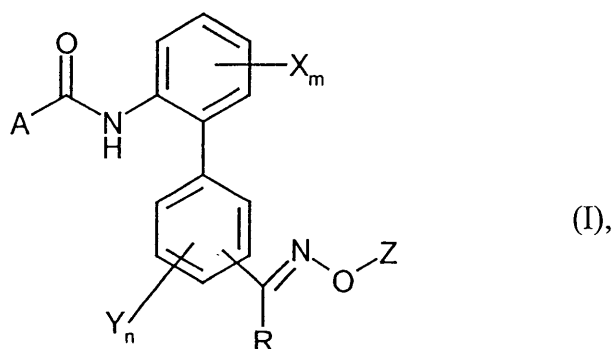
40

【0003】

今回、式 (I)

【0004】

【化 7 9】



10

## 【 0 0 0 5 】

[ 式中、

R は水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_6$ -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  $C_1 - C_6$ -ハロゲノアルキルを示し、

Z は水素、 $C_1 - C_6$ -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  $C_1 - C_6$ -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、 $C_1 - C_8$ -アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_6$ -ハロゲノアルキル、 $C_1 - C_8$ -アルコキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_6$ -ハロゲノアルコキシ、 $C_1 - C_8$ -アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_6$ -ハロゲノアルキルチオ、 $C_2 - C_8$ -アルケニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_2 - C_8$ -ハロゲノアルケニルオキシ、 $C_3 - C_8$ -アルキニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_3 - C_8$ -ハロゲノアルキニルオキシ、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_8$ -アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_8$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_8$ -アルキルスルホニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_8$ -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  $C_1 - C_8$ -ハロゲノアルキルスルホニル又は  $C_1 - C_6$ -アルコキシイミノ- $C_1 - C_6$ -アルキルを示し、

20

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、

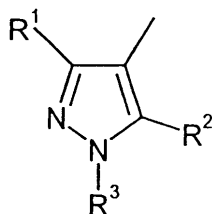
30

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

## 【 0 0 0 6 】

## 【 化 8 0 】



40

## 【 0 0 0 7 】

の基を示し、ここで

)  $R^1$  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、

$R^2$  は水素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -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、

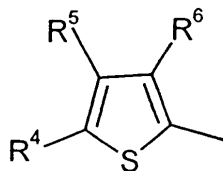
$R^3$  は水素、 $C_2 - C_4$  - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキル、ヒドロキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルキルチオ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルキルチオ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$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

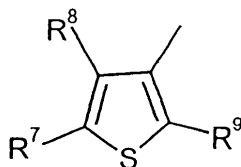
$R^6$  はハロゲン、シアノ又は  $C_1 - C_4$  - アルキルもしくは1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する  $C_1 - C_4$  - ハロゲノアルコキシを示すか、

あるいは

A は式

【 0 0 1 0 】

【 化 8 2 】



【 0 0 1 1 】

10

の基を示し、ここで

R<sup>7</sup>及びR<sup>8</sup>は互いに独立してそれぞれ水素、ハロゲン、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し、

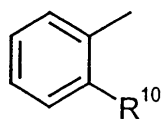
R<sup>9</sup>は水素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルを示すか、又はハロゲンを示すか、

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

R<sup>10</sup>は水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、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、1～5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルコキシを示すか、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、

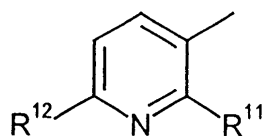
あるいは

A は式

30

【 0 0 1 4 】

【 化 8 4 】



【 0 0 1 5 】

の基を示し、ここで

R<sup>11</sup>はハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、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、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルチオ、1～5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルキルチオを示すか、又は1～5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルコキシを示し、

40

R<sup>12</sup>は水素、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、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、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルチオ、1～5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロゲノアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルスルフィニルを示すか、又はC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルスルホニルを示すか、

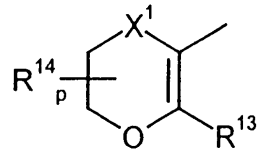
あるいは

A は式

【 0 0 1 6 】

50

【化 8 5】



【 0 0 1 7 】

の基を示し、ここで

R<sup>13</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - 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<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルを示し、

10

R<sup>14</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルを示し、

X<sup>1</sup>は硫黄原子を示すか、SO、SO<sub>2</sub>もしくはCH<sub>2</sub>を示し、

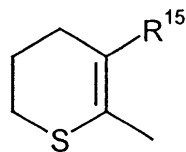
pは0、1又は2を示すか、

あるいは

Aは式

【 0 0 1 8 】

【化 8 6】



20

【 0 0 1 9 】

の基を示し、ここで

R<sup>15</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - 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<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルを示すか、

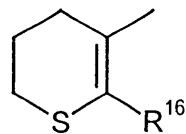
あるいは

Aは式

【 0 0 2 0 】

【化 8 7】

30



【 0 0 2 1 】

の基を示し、ここで

R<sup>16</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - 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<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルを示すか、

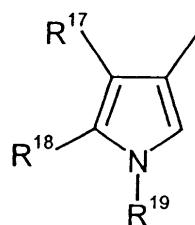
あるいは

Aは式

【 0 0 2 2 】

【化 8 8】

40



50

## 【 0 0 2 3 】

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、

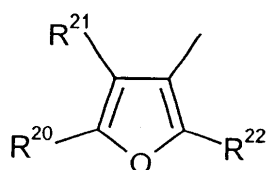
10

あるいは

Aは式

## 【 0 0 2 4 】

## 【 化 8 9 】



20

## 【 0 0 2 5 】

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、

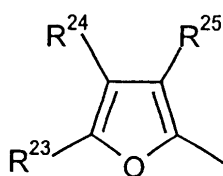
$R^{22}$ は水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキルを示すか、又は1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aは式

## 【 0 0 2 6 】

## 【 化 9 0 】



30

## 【 0 0 2 7 】

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、

40

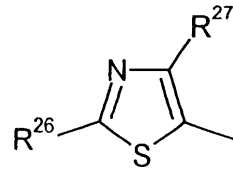
$R^{25}$ は水素、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキルを示すか、又は1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 - C_4$ -ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aは式

## 【 0 0 2 8 】

## 【 化 9 1 】



## 【 0 0 2 9 】

の基を示し、ここで

R<sup>26</sup>は水素、ハロゲン、アミノ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルアミノ、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル) アミノ、シアノ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - 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<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルを示し、

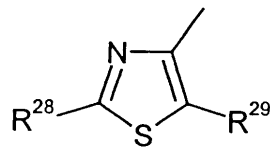
R<sup>27</sup>はハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aは式

## 【 0 0 3 0 】

## 【 化 9 2 】



## 【 0 0 3 1 】

の基を示し、ここで

R<sup>28</sup>は水素、ハロゲン、アミノ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルアミノ、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル) アミノ、シアノ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - 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<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルを示し、

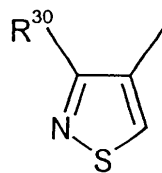
R<sup>29</sup>はハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aは式

## 【 0 0 3 2 】

## 【 化 9 3 】



## 【 0 0 3 3 】

の基を示し、ここで

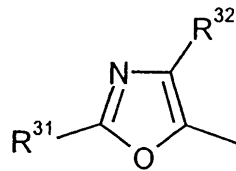
R<sup>30</sup>はハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル又は1 ~ 5個のハロゲン原子を有するC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルを示すか、

あるいは

Aは式

## 【 0 0 3 4 】

## 【 化 9 4 】



【 0 0 3 5 】

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、

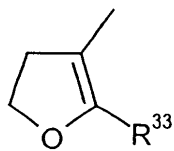
あるいは

Aは式

【 0 0 3 6 】

【 化 9 5 】

10



【 0 0 3 7 】

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、

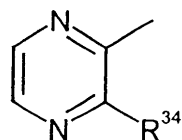
あるいは

Aは式

【 0 0 3 8 】

【 化 9 6 】

20



【 0 0 3 9 】

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。

【 0 0 4 0 】

さらに、式 ( I ) のビフェニルカルボキシアミド類は、

a ) 式 ( I I )

【 0 0 4 1 】

【 化 9 7 】

30

40



【 0 0 4 2 】

[ 式中、

Aは上記で定義したとおりであり、

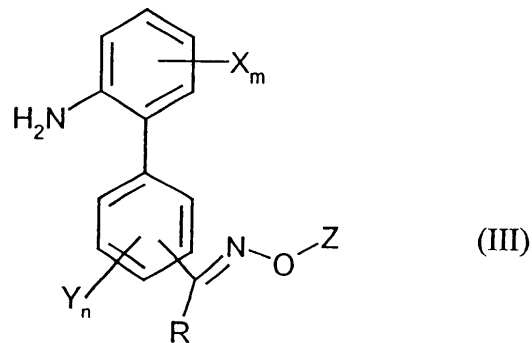
Gはハロゲン、ヒドロキシ又はC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシを示す ]

50

のカルボン酸誘導体を式 ( I I I )

【 0 0 4 3 】

【 化 9 8 】



10

【 0 0 4 4 】

[ 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 ]

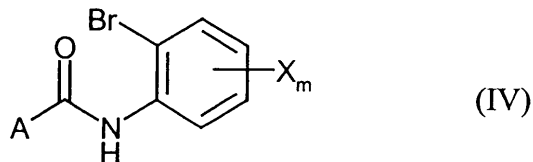
のアニン誘導体と、適宜触媒の存在下、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釈剤の存在下で反応させるか、

あるいは

b) 式 ( I V )

【 0 0 4 5 】

【 化 9 9 】



20

【 0 0 4 6 】

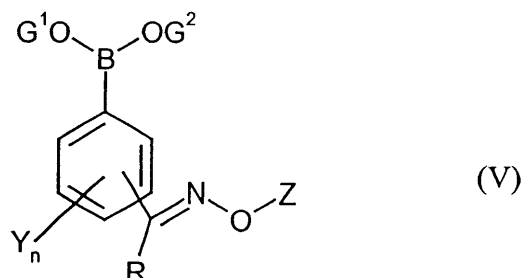
[ 式中、

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 )

【 0 0 4 7 】

【 化 1 0 0 】



30

40

【 0 0 4 8 】

[ 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、

G<sup>1</sup>及びG<sup>2</sup>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、

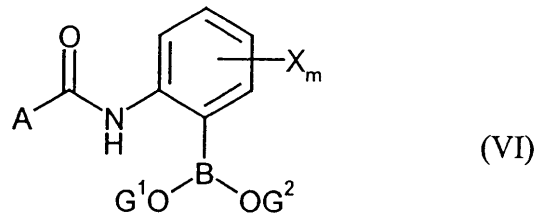
あるいは

50

c) 式 (VI)

【0049】

【化101】



10

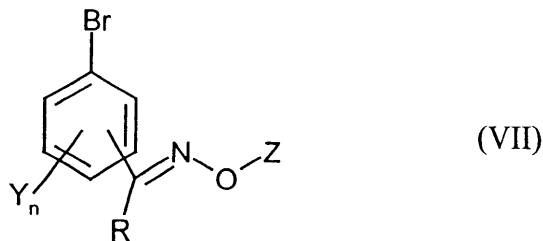
【0050】

[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、  
 G<sup>1</sup>及びG<sup>2</sup>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)

【0051】

【化102】



20

【0052】

[式中、

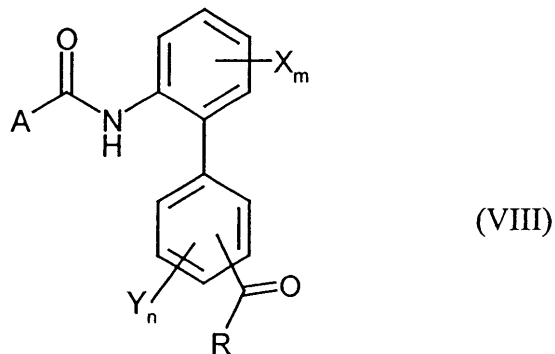
R、Z、Y及びnはそれぞれ上記で定義したとおりである]  
 のフェニルオキシム誘導体と、触媒の存在下、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釈剤の存在下で反応させるか、  
 あるいは

30

d) 式 (VIII)

【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]  
 のビフェニルアシル誘導体を式 (IX)

Z - O - NH<sub>2</sub>    x HCl                      (IX)

50

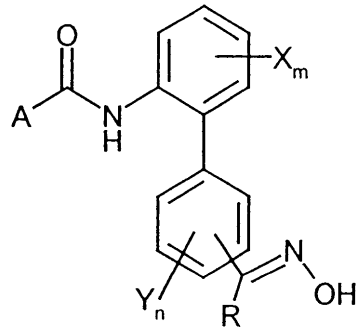


[ 式中、Z は上記で定義したとおりである ]  
 のアルコキシアミンと、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釈剤の存在下で反応させるか、  
 あるいは

e) 式 ( I - a )

【 0 0 5 5 】

【 化 1 0 4 】



(I-a)

10

【 0 0 5 6 】

[ 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

Z<sup>1</sup> - E ( X )

[ 式中、

Z<sup>1</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - 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

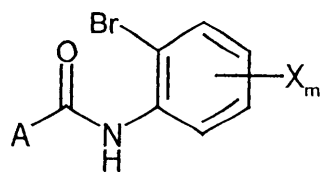
Z<sup>1</sup>とEは一緒になってジ - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルサルフェートを示す ]

の化合物と、適宜酸結合剤の存在下及び適宜希釈剤の存在下で反応させるか、  
 あるいは

f) 式 ( I V )

【 0 0 5 7 】

【 化 1 0 5 】



(IV)

30

【 0 0 5 8 】

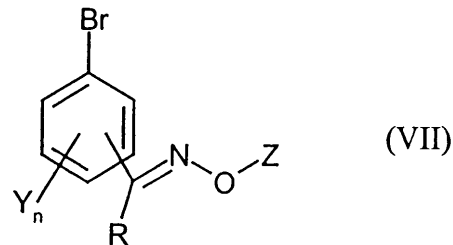
[ 式中、

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 I I )

40

【 0 0 5 9 】

【 化 1 0 6 】



## 【 0 0 6 0 】

[ 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、パラジウムもしくは白金触媒の存在下及び 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。

## 【 0 0 6 1 】

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。

## 【 0 0 6 2 】

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。

## 【 0 0 6 3 】

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る。

## 【 0 0 6 4 】

R は好ましくは水素、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - 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 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロゲノアルキルを示す。

## 【 0 0 6 5 】

Z は好ましくは水素、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルあるいは 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。

## 【 0 0 6 6 】

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、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - 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 C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> - ハロゲノアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - 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 C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> - ハロゲノアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - 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 C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> - ハロゲノアルキルチオ、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - ハロゲノアルケニルオキシ、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - アルキニルオキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - ハロゲノアルキニルオキシ、C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub> - シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - 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 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ハロゲノアルキルスルホニルを示すか、又は C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシイミノ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルを示す。

## 【 0 0 6 7 】

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。

## 【 0 0 6 8 】

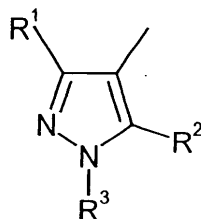
n は好ましくは 0 ~ 4 の整数を示し、ここで n が 2、3 又は 4 を示す場合、Y は同一もしくは異なる基を示す。

【 0 0 6 9 】

Aは好ましくは式

【 0 0 7 0 】

【 化 1 0 7 】



10

【 0 0 7 1 】

の基を示し、ここで

） $R^1$ 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 $C_1 - C_2$ -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 $C_1 - C_2$ -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、

$R^2$ 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、

20

$R^3$ 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 $C_1 - C_2$ -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

） $R^1$ 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 $C_1 - C_2$ -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 $C_1 - C_2$ -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

$R^2$ はフッ素を示し、

$R^3$ 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 $C_1 - C_2$ -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

） $R^1$ 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 $C_1 - C_2$ -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 $C_1 - C_2$ -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

$R^2$ はフッ素を示し、

$R^3$ 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 $C_1 - C_2$ -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。

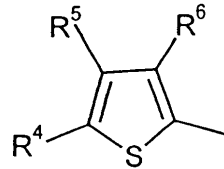
【 0 0 7 2 】

Aはさらに、好ましくは式

【 0 0 7 3 】

【 化 1 0 8 】

50



【 0 0 7 4 】

の基を示し、ここで

R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示し、  
R<sup>6</sup>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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルコキシを示す。

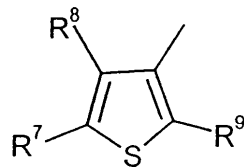
10

【 0 0 7 5 】

Aはさらに、好ましくは式

【 0 0 7 6 】

【 化 1 0 9 】



20

【 0 0 7 7 】

の基を示し、ここで

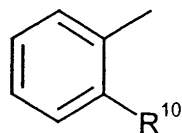
R<sup>7</sup>及びR<sup>8</sup>は互いに独立してそれぞれ水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示し、  
R<sup>9</sup>は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル又はエチルを示す。

【 0 0 7 8 】

Aはさらに、好ましくは式

【 0 0 7 9 】

【 化 1 1 0 】



30

【 0 0 8 0 】

の基を示し、ここで

R<sup>10</sup>は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルチオを示す。

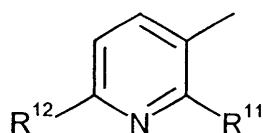
40

【 0 0 8 1 】

Aはさらに、好ましくは式

【 0 0 8 2 】

【 化 1 1 1 】



## 【 0 0 8 3 】

の基を示し、ここで

R<sup>11</sup>はフッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - 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 C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> - 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 C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> - ハロゲノアルコキシを示し、

10

R<sup>12</sup>は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - 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 C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> - 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 C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> - ハロゲノアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> - アルキルスルフィニル又は C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> - アルキルスルホニルを示す。

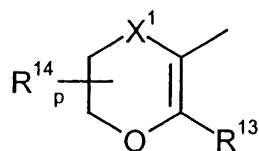
## 【 0 0 8 4 】

A はさらに、好ましくは式

## 【 0 0 8 5 】

20

## 【 化 1 1 2 】



## 【 0 0 8 6 】

の基を示し、ここで

R<sup>13</sup>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 C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> - ハロゲノアルキルを示し、

30

R<sup>14</sup>はメチル又はエチルを示し、

X<sup>1</sup>は硫黄原子を示すか、S O、S O<sub>2</sub>もしくは C H<sub>2</sub>を示し、

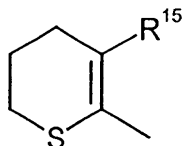
p は 0、1 又は 2 を示す。

## 【 0 0 8 7 】

A はさらに、好ましくは式

## 【 0 0 8 8 】

## 【 化 1 1 3 】



40

## 【 0 0 8 9 】

の基を示し、ここで

R<sup>15</sup>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 C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> - ハロゲノアルキルを示す。

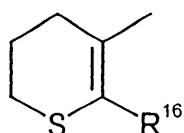
## 【 0 0 9 0 】

A はさらに、好ましくは式

## 【 0 0 9 1 】

## 【 化 1 1 4 】

50



【 0 0 9 2 】

の基を示し、ここで

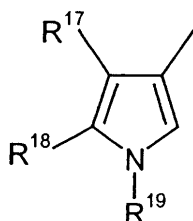
R<sup>16</sup>はメチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示す。

【 0 0 9 3 】

Aはさらに、好ましくは式

【 0 0 9 4 】

【 化 1 1 5 】



【 0 0 9 5 】

の基を示し、ここで

R<sup>17</sup>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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示し、

R<sup>18</sup>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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示し、

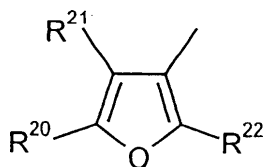
R<sup>19</sup>は水素、メチル、エチル、1～5個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-アルコキシ-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-アルキル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、メチルスルホニル又はジメチルアミノスルホニルを示す。

【 0 0 9 6 】

Aはさらに、好ましくは式

【 0 0 9 7 】

【 化 1 1 6 】



【 0 0 9 8 】

の基を示し、ここで

R<sup>20</sup>及びR<sup>21</sup>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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示し、

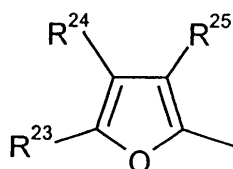
R<sup>22</sup>は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び／又は臭素原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示す。

【 0 0 9 9 】

Aはさらに、好ましくは式

【 0 1 0 0 】

【 化 1 1 7 】



## 【 0 1 0 1 】

の基を示し、ここで

R<sup>23</sup>及びR<sup>24</sup>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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示し、

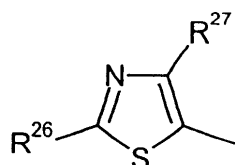
R<sup>25</sup>は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチルを示すか、又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示す。

## 【 0 1 0 2 】

Aはさらに、好ましくは式

## 【 0 1 0 3 】

## 【 化 1 1 8 】



## 【 0 1 0 4 】

の基を示し、ここで

R<sup>26</sup>は水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルアミノ、ジ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示し、

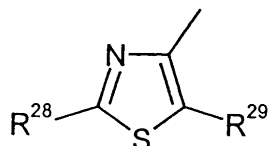
R<sup>27</sup>はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示す。

## 【 0 1 0 5 】

Aはさらに、好ましくは式

## 【 0 1 0 6 】

## 【 化 1 1 9 】



## 【 0 1 0 7 】

の基を示し、ここで

R<sup>28</sup>は水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルアミノ、ジ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示し、

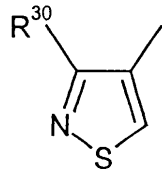
R<sup>29</sup>はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示す。

## 【 0 1 0 8 】

Aはさらに、好ましくは式

## 【 0 1 0 9 】

## 【 化 1 2 0 】



## 【 0 1 1 0 】

の基を示し、ここで

R<sup>30</sup>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C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示す。

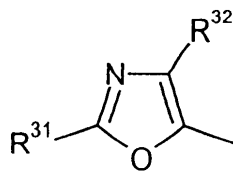
10

## 【 0 1 1 1 】

Aはさらに、好ましくは式

## 【 0 1 1 2 】

## 【 化 1 2 1 】



20

## 【 0 1 1 3 】

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、

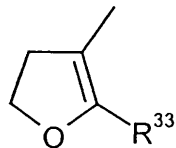
R<sup>32</sup>はフッ素、塩素、臭素、メチル又はエチルを示す。

## 【 0 1 1 4 】

Aはさらに、好ましくは式

## 【 0 1 1 5 】

## 【 化 1 2 2 】



30

## 【 0 1 1 6 】

の基を示し、ここで

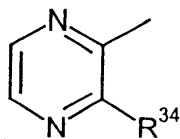
R<sup>33</sup>はメチル、エチル又は1～5個のフッ素、塩素及び/又は臭素原子を有するC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-ハロゲノアルキルを示す。

## 【 0 1 1 7 】

Aはさらに、好ましくは式

## 【 0 1 1 8 】

## 【 化 1 2 3 】



40

## 【 0 1 1 9 】

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。

## 【 0 1 2 0 】

50



Rは特に好ましくは水素、 $C_1 - C_4$ -アルキルを示す。

【0121】

Zは特に好ましくは水素、 $C_1 - C_4$ -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す。

10

【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の数値を示し、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。

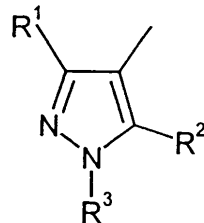
【0125】

20

Aは特に好ましくは式

【0126】

【化124】



30

【0127】

の基を示し、ここで

)  $R^1$ 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、

$R^2$ 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、

$R^3$ 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が、

40

あるいは

)  $R^1$ 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、

$R^2$ はフッ素を示し、

$R^3$ 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が、

50

あるいは

)  $R^1$ 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、

$R^2$ はフッ素を示し、

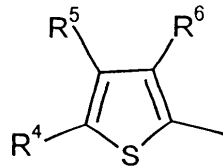
$R^3$ は水素、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル又はフェニルを示す。

【0128】

Aはさらに、特に好ましくは式

【0129】

【化125】



【0130】

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、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、

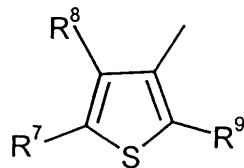
$R^6$ はフッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ又はトリクロロメトキシを示す。

【0131】

Aはさらに、特に好ましくは式

【0132】

【化126】



【0133】

の基を示し、ここで

$R^7$ 及び $R^8$ 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、

$R^9$ 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】

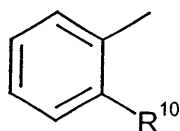
【化127】

10

20

30

40



## 【 0 1 3 6 】

の基を示し、ここで

R<sup>10</sup>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。

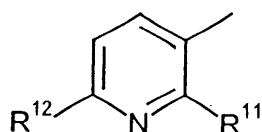
10

## 【 0 1 3 7 】

Aはさらに、特に好ましくは式

## 【 0 1 3 8 】

## 【 化 1 2 8 】



20

## 【 0 1 3 9 】

の基を示し、ここで

R<sup>11</sup>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

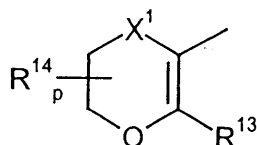
R<sup>12</sup>は水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、i - ブチル、sec - ブチル、tert - ブチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、トリクロロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、メチルスルフィニル又はメチルスルホニルを示す。

## 【 0 1 4 0 】

Aはさらに、特に好ましくは式

## 【 0 1 4 1 】

## 【 化 1 2 9 】



40

## 【 0 1 4 2 】

の基を示し、ここで

R<sup>13</sup>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、

R<sup>14</sup>はメチル又はエチルを示し、

X<sup>1</sup>は硫黄原子を示すか、SO、SO<sub>2</sub>又はCH<sub>2</sub>を示し、

50

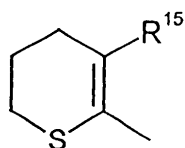
p は 0、1 又は 2 を示す。

【 0 1 4 3 】

A はさらに、特に好ましくは式

【 0 1 4 4 】

【 化 1 3 0 】



10

【 0 1 4 5 】

の基を示し、ここで

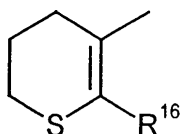
R<sup>15</sup> はメチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示す。

【 0 1 4 6 】

A はさらに、特に好ましくは式

【 0 1 4 7 】

【 化 1 3 1 】



20

【 0 1 4 8 】

の基を示し、ここで

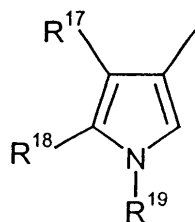
R<sup>16</sup> はメチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示す。

【 0 1 4 9 】

A はさらに、特に好ましくは式

【 0 1 5 0 】

【 化 1 3 2 】



30

【 0 1 5 1 】

の基を示し、ここで

R<sup>17</sup> 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、

R<sup>18</sup> 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、

R<sup>19</sup> 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。

【 0 1 5 2 】

A はさらに、特に好ましくは式

【 0 1 5 3 】

【 化 1 3 3 】

40



## 【 0 1 5 4 】

の基を示し、ここで

R<sup>20</sup>及びR<sup>21</sup>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

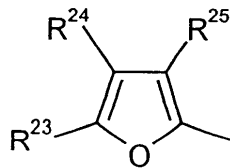
R<sup>22</sup>は水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示す。

## 【 0 1 5 5 】

Aはさらに、特に好ましくは式

## 【 0 1 5 6 】

## 【 化 1 3 4 】



20

## 【 0 1 5 7 】

の基を示し、ここで

R<sup>23</sup>及びR<sup>24</sup>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、

R<sup>25</sup>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。

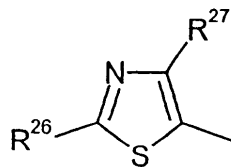
30

## 【 0 1 5 8 】

Aはさらに、特に好ましくは式

## 【 0 1 5 9 】

## 【 化 1 3 5 】



40

## 【 0 1 6 0 】

の基を示し、ここで

R<sup>26</sup>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、

R<sup>27</sup>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。

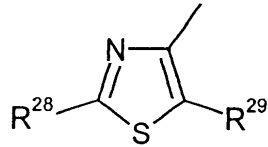
## 【 0 1 6 1 】

Aはさらに、特に好ましくは式

## 【 0 1 6 2 】

50

## 【化 1 3 6】



## 【 0 1 6 3】

の基を示し、ここで

R<sup>28</sup>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

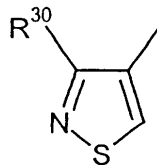
R<sup>29</sup>はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示す。

## 【 0 1 6 4】

Aはさらに、特に好ましくは式

## 【 0 1 6 5】

## 【化 1 3 7】



20

## 【 0 1 6 6】

の基を示し、ここで

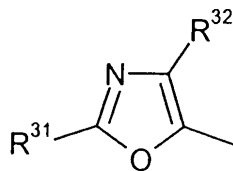
R<sup>30</sup>はフッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示す。

## 【 0 1 6 7】

Aはさらに、特に好ましくは式

## 【 0 1 6 8】

## 【化 1 3 8】



30

## 【 0 1 6 9】

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、

40

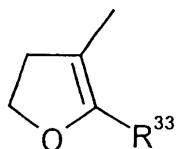
R<sup>32</sup>はフッ素、塩素、臭素、メチル又はエチルを示す。

## 【 0 1 7 0】

Aはさらに、特に好ましくは式

## 【 0 1 7 1】

## 【化 1 3 9】



50

## 【 0 1 7 2 】

の基を示し、ここで

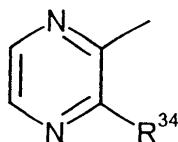
$R^{33}$ はメチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル又はトリクロロメチルを示す。

## 【 0 1 7 3 】

Aはさらに、特に好ましくは式

## 【 0 1 7 4 】

## 【 化 1 4 0 】



10

## 【 0 1 7 5 】

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。

## 【 0 1 7 6 】

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

## 【 0 1 7 7 】

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。

## 【 0 1 7 8 】

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。

## 【 0 1 7 9 】

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。

30

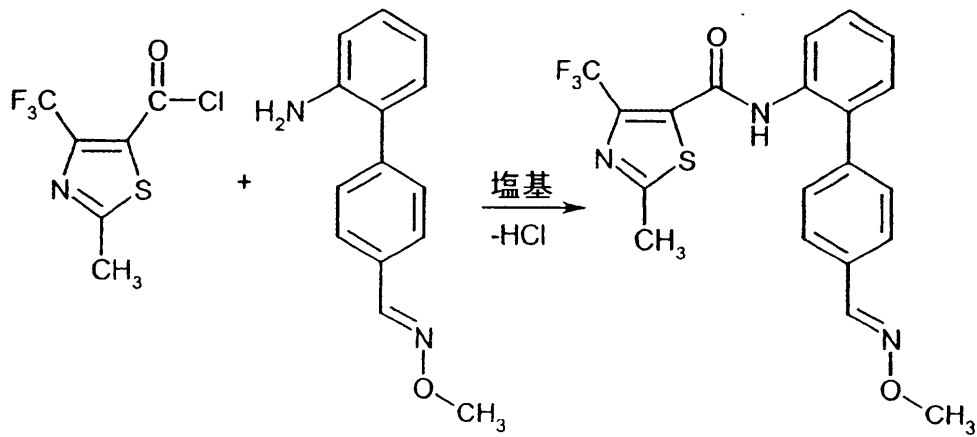
## 【 0 1 8 0 】

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。

## 【 0 1 8 1 】

## 【 化 1 4 1 】

40



10

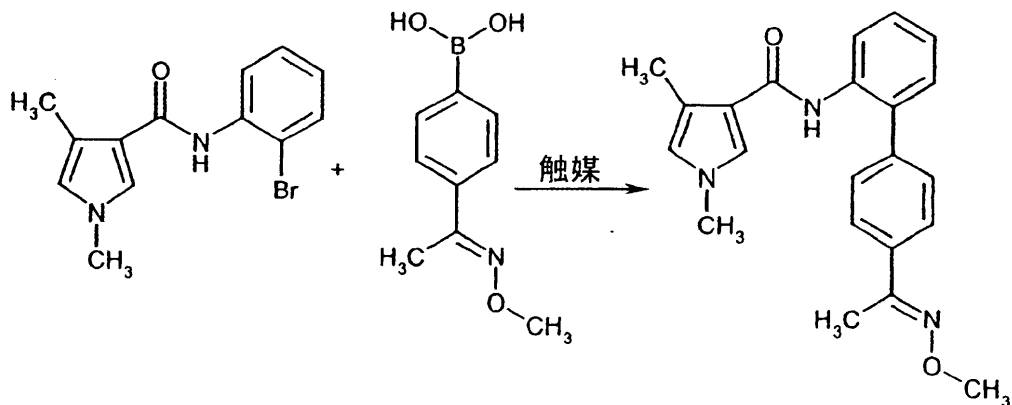
## 【 0 1 8 2 】

出発材料としての 2'-ブromo-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。

## 【 0 1 8 3 】

## 【 化 1 4 2 】

20



30

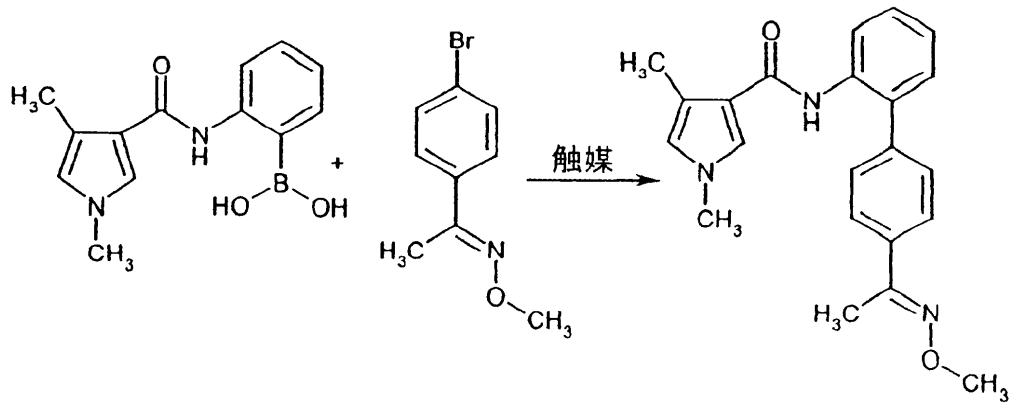
## 【 0 1 8 4 】

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romo-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。

## 【 0 1 8 5 】

## 【 化 1 4 3 】





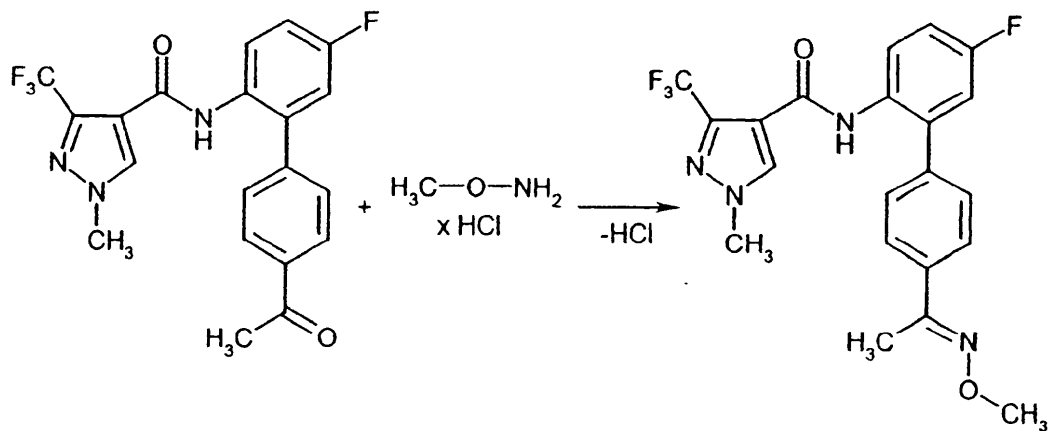
10

【 0 1 8 6 】

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。

【 0 1 8 7 】

【 化 1 4 4 】



20

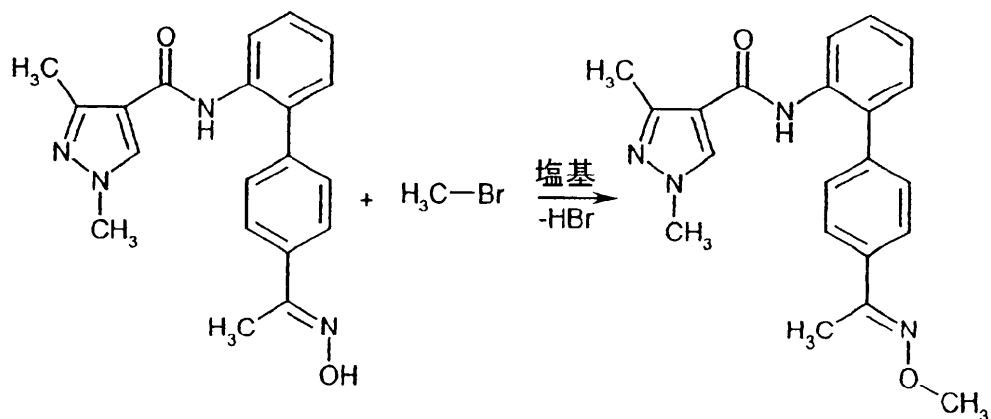
30

【 0 1 8 8 】

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。

【 0 1 8 9 】

【 化 1 4 5 】



10

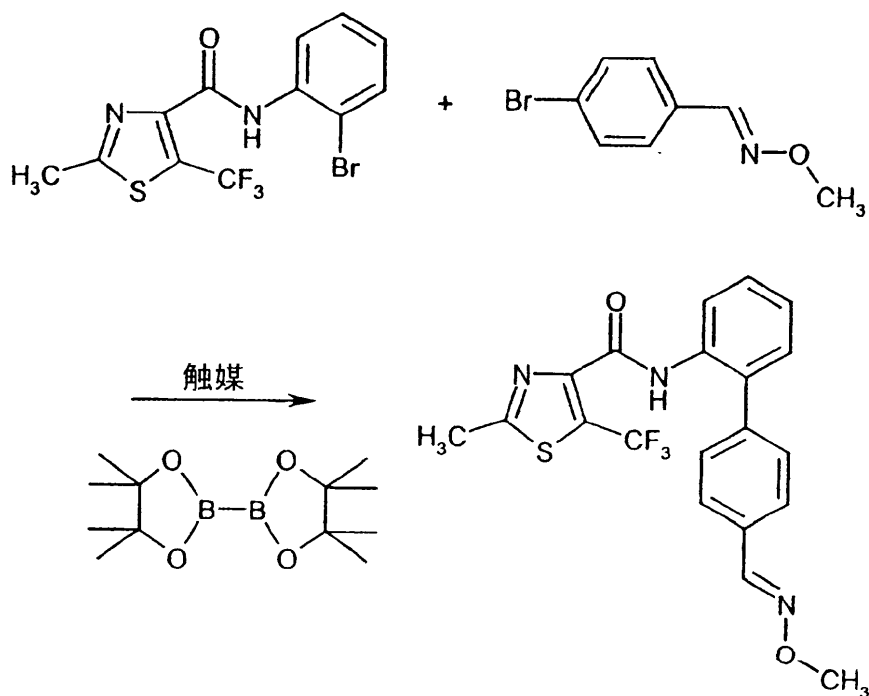
## 【 0 1 9 0 】

出発材料としての 2'-ブromo-5-フルオロチアゾール-4-カルボキシアニリド及び 1-ブromo-4-メトキシミノメチル-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。

## 【 0 1 9 1 】

## 【 化 1 4 6 】

20



30

40

## 【 0 1 9 2 】

## 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。

## 【 0 1 9 3 】

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 93/11 117、EP-A 0 545 099、EP-A 0 589 30

50

1 及び E P - A 0 5 8 9 3 1 3 を参照されたい)。

【 0 1 9 4 】

式 ( I I I ) 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。

【 0 1 9 5 】

式 ( I I I ) 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

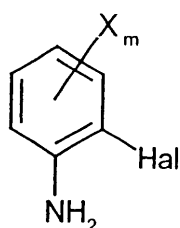
【 0 1 9 6 】

式 ( I I I ) のアニリン誘導体はさらに、

g ) 一般式 ( X I )

【 0 1 9 7 】

【 化 1 4 7 】



(XI)

20

【 0 1 9 8 】

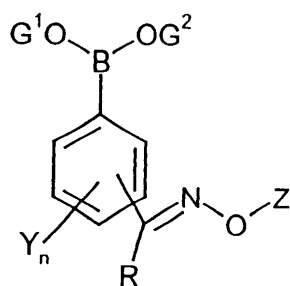
[ 式中、

X 及び m はそれぞれ上記で定義したとおりであり、  
H a l はハロゲンを示す]

の 2 - ハロゲノアニリン誘導体を式 ( V )

【 0 1 9 9 】

【 化 1 4 8 】



(V)

30

【 0 2 0 0 】

[ 式中、

R、Z、Y、n、G<sup>1</sup> 及び G<sup>2</sup> 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、

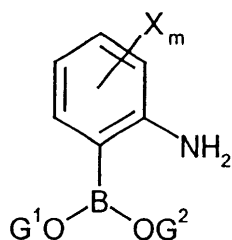
あるいは

h ) 式 ( X I I )

【 0 2 0 1 】

【 化 1 4 9 】

40



(XII)

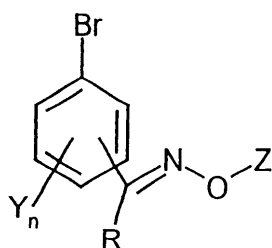
【 0 2 0 2 】

〔 式中、

X、m、G<sup>1</sup>及びG<sup>2</sup>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 ( V I I )

【 0 2 0 3 】

【 化 1 5 0 】



(VII)

【 0 2 0 4 】

〔 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。

【 0 2 0 5 】

式 ( X I ) 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る。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。H a l 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。

【 0 2 0 6 】

式 ( X I ) 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。

【 0 2 0 7 】

式 ( X I I ) 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る。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。G<sup>1</sup>及びG<sup>2</sup>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。

【 0 2 0 8 】

式 ( X I I ) のアニリンボロン酸は商業的に入手可能である。

【 0 2 0 9 】

式 ( I V ) 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る。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。

10

20

30

40

50

## 【 0 2 1 0 】

式 ( I V ) 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 ( W O 9 1 / 0 1 3 1 1 、 E P - A 0 3 7 1 9 5 0 を参照されたい ) 。

## 【 0 2 1 1 】

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。G<sup>1</sup> 及び G<sup>2</sup> 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

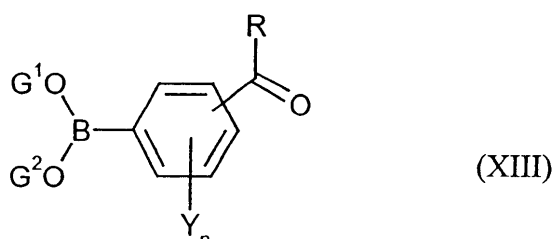
## 【 0 2 1 2 】

式 ( V ) のボロン酸誘導体は新規であり、

i ) 式 ( X I I I )

## 【 0 2 1 3 】

## 【 化 1 5 1 】



20

## 【 0 2 1 4 】

[ 式中、

R、Y、n、G<sup>1</sup> 及び G<sup>2</sup> 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 )



[ 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。

## 【 0 2 1 5 】

式 ( X I I I ) 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る。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。G<sup>1</sup> 及び G<sup>2</sup> 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。

## 【 0 2 1 6 】

式 ( X I I I ) のフェニルボロン酸は商業的に入手可能である。

40

## 【 0 2 1 7 】

式 ( V I ) 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る。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。G<sup>1</sup> 及び G<sup>2</sup> 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。

## 【 0 2 1 8 】

式 ( V I ) 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

【 0 2 1 9 】

【 化 1 5 2 】



【 0 2 2 0 】

[ 式中、

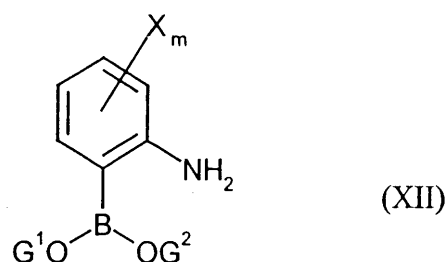
A 及び G はそれぞれ上記で定義したとおりである ]

10

のカルボン酸誘導体を式 (X I I )

【 0 2 2 1 】

【 化 1 5 3 】



20

【 0 2 2 2 】

[ 式中、

X、m、G<sup>1</sup> 及び G<sup>2</sup> 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。

【 0 2 2 3 】

式 (V I I ) 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

【 0 2 2 4 】

式 (V I I ) 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)。

【 0 2 2 5 】

式 (V I I I ) 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

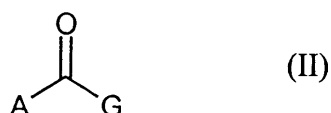
【 0 2 2 6 】

式 (V I I I ) のビフェニルアシル誘導体は新規である。それらは、

k) 式 ( I I )

【 0 2 2 7 】

【 化 1 5 4 】



50

【 0 2 2 8 】

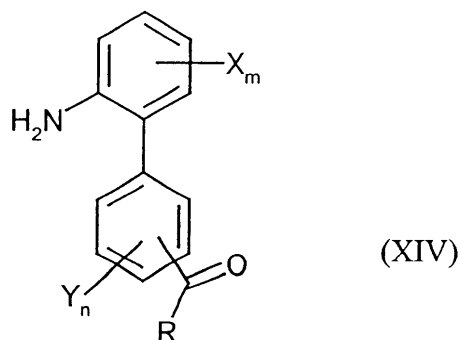
[ 式中、

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 ( X I V )

【 0 2 2 9 】

【 化 1 5 5 】



10

【 0 2 3 0 】

[ 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希釈剤の存在下で反応させる

ことにより製造され得る。

20

【 0 2 3 1 】

式 ( X I V ) 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。

【 0 2 3 2 】

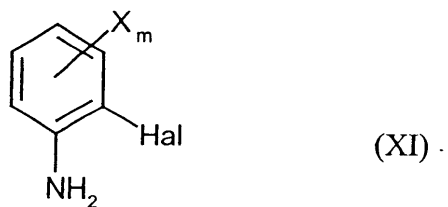
式 ( X I V ) の 2 - ベンズアルデヒド - アニリン誘導体は新規である。それらは、

1 ) 式 ( X I )

30

【 0 2 3 3 】

【 化 1 5 6 】



【 0 2 3 4 】

[ 式中、

X 及び m はそれぞれ上記で定義したとおりであり、

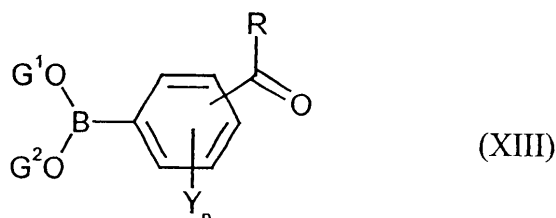
H a l はハロゲンを示す ]

のアニリン誘導体を式 ( X I I I )

【 0 2 3 5 】

【 化 1 5 7 】

40



## 【 0 2 3 6 】

[ 式中、

R、Y、n、G<sup>1</sup>及びG<sup>2</sup>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。

## 【 0 2 3 7 】

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。

## 【 0 2 3 8 】

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。

## 【 0 2 3 9 】

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。

## 【 0 2 4 0 】

式(IX)のアルコキシアミン類は商業的に入手可能である。

## 【 0 2 4 1 】

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。

## 【 0 2 4 2 】

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。

## 【 0 2 4 3 】

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、Z<sup>1</sup>は好ましくはC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-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。

## 【 0 2 4 4 】

式(X)の化合物は商業的に入手可能である。

## 【 0 2 4 5 】

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

10

20

30

40

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、ジアザビスクロオクタン (DABCO)、ジアザビスクロノネン (DBN) もしくはジアザビスクロウンデセン (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され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 - メチルホルムアニリド、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。

#### 【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 (II) 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 (III) 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。

#### 【0250】

本発明に従う方法 (b) を行う場合、式 (IV) 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。

#### 【0251】

本発明に従う方法 (c) を行う場合、式 (VI) 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 (VII) 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。

## 【 0 2 5 2 】

本発明に従う方法 ( d ) を行う場合、式 ( V I I I ) 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 ( I X ) 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。

## 【 0 2 5 3 】

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

## 【 0 2 5 4 】

本発明に従う方法 ( f ) を行う場合、式 ( I V ) 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 ( V I I ) 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

## 【 0 2 5 5 】

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。

## 【 0 2 5 6 】

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

30

## 【 0 2 5 7 】

殺バクテリア剤を作物保護においてシュードモナス ( *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 ( *Streptomycetaceae* ) の抑制に用いることができる。

## 【 0 2 5 8 】

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・カムペストリス *p v .* オリザエ ( *Xanthomonas campestris p v . oryzae* ) ；

40

シュードモナス ( *Pseudomonas* ) 種、例えばシュードモナス・シリंगाエ *p v .* ラクリマンス ( *Pseudomonas syringae p v . lachrymans* ) ；

エルウィニア ( *Erwinia* ) 種、例えばエルウィニア・アミロボラ ( *Erwinia 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*) ;  
 シュードペロノスポラ(*Pseudoperonospora*) 種、例えばシュードペロ  
 ノスポラ・ヒュミリ(*Pseudoperonospora humili*)又はシュード  
 ペロノスポラ・クベンシス(*Pseudoperonospora cubensis*)  
 ;  
 プラスモパラ(*Plasmopara*) 種、例えばプラスモパラ・ヴィチコラ(*Plasmopara viticola*) ;  
 プレミア(*Bremia*) 種、例えばプレミア・ラクツカエ(*Bremia lactucae*) ;  
 ペロノスポラ(*Peronospora*) 種、例えばペロノスポラ・ピシ(*Peronospora pisi*) 又は *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(*Pyrenophora teres*) 又は *P. graminea* )  
 (分生子(*Conidia*)型: ドレチュスレラ(*Drechslera*)、Syn: ヘルミ  
 ントスポリウム(*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: ヘルミントスポリウム) ;  
 ウロミセス(*Uromyces*) 種、例えばウロミセス・アペンディクラツス(*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 nuda*) 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 brassicae*) ; 及び  
シュードセルコスポレラ(*Pseudocercospora*)種、例えばシュードセルコスポレラ・ヘルポトリコイデス(*Pseudocercospora herpotrichoides*)。

【0259】

活性化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壌を処理することを可能にする。

【0260】

本発明に従う活性化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、ボドスファエラ、アルテルナリア及びコレトツリウム種に対して用いて特に成功することができる。稲の病気、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。

【0261】

本発明に従う活性化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であることができ、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、挙げることができる例は葉、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。

【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。

【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。

【0265】

挙げること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(担子菌類)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(*Aspe*

10

20

30

40

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・グラウカム (*Penicillium glaucum*)、  
 ポリポルス (*Polyporus*)、例えばポリポルス・ベルシコロール (*Polyporus versicolor*)、  
 アウレオバシジウム (*Aureobasidium*)、例えばアウレオバシジウム・プル  
 ランス (*Aureobasidium pullulans*)、  
 スクレロフォマ (*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 (*Tricoderma*)、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  
 スタフィロコッカス (*Staphylococcus*)、例えばスタフィロコッカス・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ULV  
 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  
 シクロヘキサノン、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

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。

【 0 2 6 9 】

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鉱油及び植物油であることができる。

【 0 2 7 0 】

着色料、例えば酸化鉄、酸化チタン及びプルシア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。

【 0 2 7 1 】

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 % の活性化化合物を含む。

【 0 2 7 2 】

本発明に従う活性化化合物をそのまま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 ( b a c t e r i c i d e s ) 、殺ダニ剤 ( a c a r i c i d e s ) 、殺線虫剤 ( n e m a t i c i d e s ) 又は殺虫剤 ( i n s e c t i c i d e s ) とともに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。

【 0 2 7 3 】

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、ピアラフォス、ピナバクリル、ピフェニル、ピテルタノル、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、カブシマイシン、カブタフォル、カブタン、カルベンダジン、カルボキシシン、カルボン、キノメチオネート、クロベンチアゾン、クロルフエナゾール、クロロネブ、クロロピクリン、クロロタロニル、クロゾリネート、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、ドラゾキシロン、

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、フルルプリミドル、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、フォルベト、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、イブコナゾール、イプロベンフォス ( I B P )、  
 イプロジオン、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、クレソキシム - 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 - 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、メタスルホカルブ、メトフロキサム、メチラム、メトメクラ  
 ム、メトスルホバクス、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、  
 オフレース、オキサジキシル、オキサモカルブ、オキシソリニン酸、オキシカルボキシム、  
 オキシフェンチン、  
 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、フォスジフェン  
 、ピマリシン、ピペラリン、ポリオキシシ、ポリオキシソリム、プロベナゾール、プロクロ  
 ラツ、プロシミドン、プロバモカルブ、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 ( P C N B )、キノキシフェン、  
 硫黄及び硫黄調剤、  
 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、チシオフエン、チフルザミド、チオファネート - メチル、チラム、チオ  
 キシミド、トルクロフォス - 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  
 D a g g e r G、O K - 8 7 0 5、O K - 8 8 0 1、  
 - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) - - ( 2 - フェノキシエチル ) - 1 H - 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 - 1 H - 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 ) - - メトキシ - - メチル - 1 H - 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 ] - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - エタノール、  
 ( 5 R S , 6 R S ) - 6 - ヒドロキシ - 2 , 2 , 7 , 7 - テトラメチル - 5 - ( 1 H - 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  
 、  
 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 - ( 1 H - 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 ) - 1 H - 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 - [ ( ジョードメチル ) - 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 ] - 1 H - イミダゾール、

10

20

30

40

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 ' - ジブプロモ - 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 - カルボキシアニリド、
- 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 - ピリミジニルチオシアナート、
- 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 - プロベニル ) - 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 - グリコピラノシル ) - - D - グルコピラノシル ] - 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 - プロモ - 2 - ( プロモメチル ) - 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 ( OPP ) 、
- 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 - スルホンアミド、
- 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、



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 - ベンゼンスルホン  
 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：

プロノボル、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、アセタミプリド、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 - シベルメツリン、アルファメツリン、アミトラツ  
 、アベルメクチン、A Z 60541、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、  
 バシルス・ポピリアエ ( *Bacillus popilliae* )、バシルス・スファエ  
 リクス ( *Bacillus sphaericus* )、バシルス・スプチリス ( *Baci  
 llus subtilis* )、バシルス・ツリングエンシス ( *Bacillus th  
 uringiensis* )、バクロウィルス、ベアウベリア・バシアナ ( *Beauver  
 ia bassiana* )、ベアウベリア・テネラ ( *Beauveria tenella* )、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、ピフェナゼート、ピフェンツリン、ピオエタノメツリン、ピオペルメツリン、  
 B P M C、プロモフォスA、プフェンカルブ、プロプロフェジン、ブタチオフォス、ブトカ  
 ルボキシニン、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、クロルフェンピン  
 フォス、クロルフルアズリン、クロルメフォス、クロルピリフォス、クロルピリフォス M  
 、クロバボルツリン、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、シベルメツリン、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、ジメチルピンフォス、  
 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、エントモブフト  
 ラ種 (*Entomopffthora spp.*)、エスフェンバレレート、エチオフエン  
 カルブ、エチオン、エトプロフォス、エトフェンブロクス、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、フェンブロパツリン、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、フルプロシツリネート、フルシクロクスロン、フルシツリネー  
 ト、フルフェノクスロン、フルテンジン、フルバリネート、フォノフォス、フォスメチラ  
 ン、フォスチアゼート、フブフェンブロクス、フラチオカルブ、  
 グラニューローシスウィルス、  
 ハロフェノジド、HCH、ヘブテノフォス、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・アニソプリ  
 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、メピンフォス  
 、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 fumosoroseu  
 s*)、パラチオン A、パラチオン M、ベルメツリン、フェントエート、フォレート、  
 フォサロン、フォスメト、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、プロボクスル、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、リバピリン、  
 サリチオン、セブフォス、シラフルオフエン、スピノサド、スルフォテブ、スルプロフォ  
 ス、  
 タウ - フルバリネート、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、テミピンフォス、テルブフォス、テトラクロル  
 ピンフォス、テータシベルメツリン、チアメトキサン、チアプロニル、チアトリフォス、  
 シュウ酸水素チオシ克蘭、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)フェニル]-4,5-ジヒドロ-オキサゾール、  
 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-フェノキシ-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、  
 4-クロロ-2-(2-クロロ-2-メチルプロピル)-5-[(6-ヨード-3-ピリジニル)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、  
 バシルス・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、  
 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-ピリダジニル]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、  
 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(diphysic fungi)に

10

20

30

40

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 glabrata*)、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・フミガツス (*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*)、ミクロスポロン (*Microsporon*) 種、例えばミクロスポロン・カニス (*Microsporon 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】

活性化化合物はそのまま、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 (*broadcasting*)、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*) により活性化化合物を適用するか、又は活性化化合物調製物もしくは活性化化合物自身を土壌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。土壌の処理のためには、活性化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 % の量で活性化化合物を含む。

【0280】

本発明に従う活性化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化化合物、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の他の活性化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】

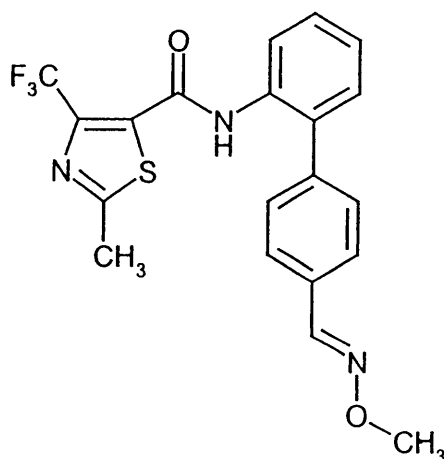
製造実施例

50

## 実施例 1

【 0 2 8 4 】

【 化 1 5 8 】



10

【 0 2 8 5 】

方法 ( a ) :

室温で、25 ml のトルエン中の 0.59 g (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 0.26 g (0.0026 モル) のトリエチルアミンで処理する。室温で、5 ml のトルエン中の 0.6 g (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。仕上げるために、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、0.81 g (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。

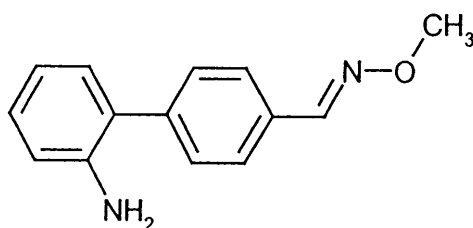
20

出発材料の製造

30

【 0 2 8 6 】

【 化 1 5 9 】



40

【 0 2 8 7 】

室温で、2.9 g (0.017 モル) の 2 - ブロモアニリン、0.68 g のテトラキス - (トリフェニルホスフィン) パラジウム、5.5 g (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 40 ml の 1, 2 - ジメトキシエタンの混合物を 35 ml の水中の 8.2 g (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。仕上げるために、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、3.8 g (2 - ブロモアニリンに基づいて理論値の 98.8 %) の 2 - ( 4

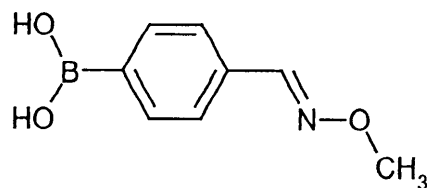
50

- 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。

$^1\text{H}$  - NMRスペクトル ( DMSO / TMS ) :  $\delta = 3.90 (3\text{H}) \text{ ppm}$ 。

【 0 2 8 8 】

【 化 1 6 0 】



10

【 0 2 8 9 】

5.0 g ( 0.033 mol ) の 4 - ホルミルフェニルボロン酸、3.4 g ( 0.041 mol ) のメトキシルアミン塩酸塩、3.4 g ( 0.041 mol ) の酢酸ナトリウム、40 ml のメタノール及び10 ml の水の混合物を室温で12時間攪拌する。仕上げるために、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℃で乾燥する。これは5.56 g ( 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。

【 0 2 9 0 】

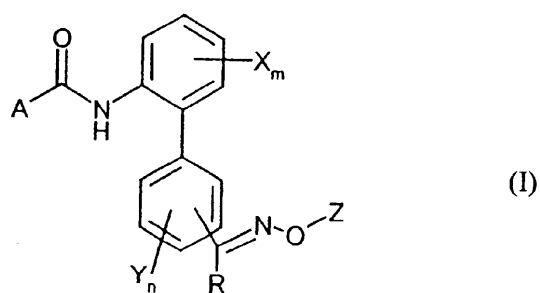
下記の表に挙げる式 ( I ) のビフェニルカルボキシアミドも上記の方法により製造される。

20

【 0 2 9 1 】

【 表 1 】

表1



10

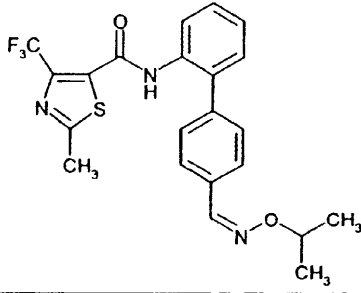
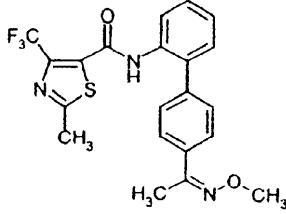
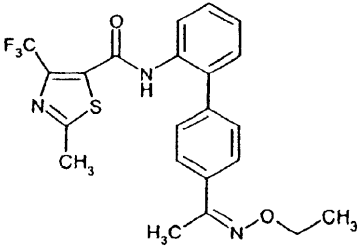
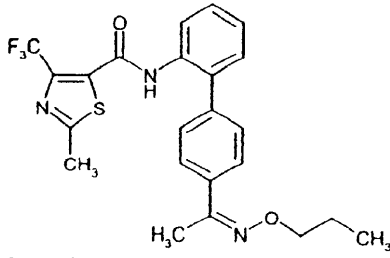
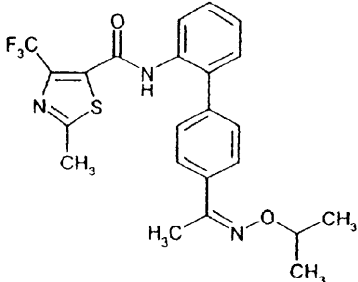
実施例番号		物理定数
2		logP 3.42 <sup>a)</sup>
3		logP 4.65 <sup>a)</sup>
4		融点107-109°C

20

30

【 0 2 9 2 】

【 表 2 】

実施例番号		物理定数
5		logP 4.23 <sup>a)</sup>
6		融点 129-131°C
7		融点 25-128°C
8		融点 110-112°C
9		融点 118-120°C

【 0 2 9 3 】

【 表 3 】

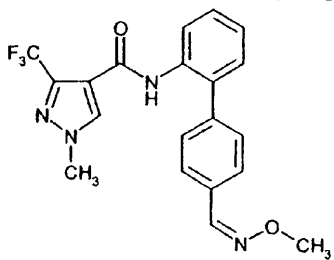
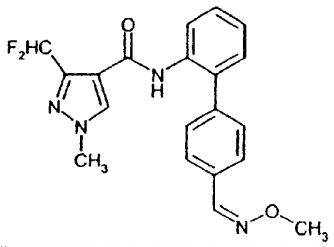
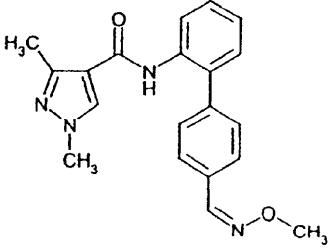
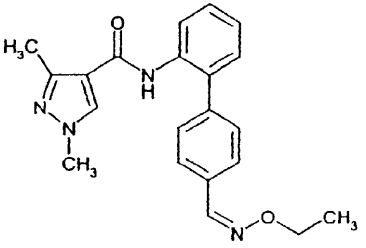
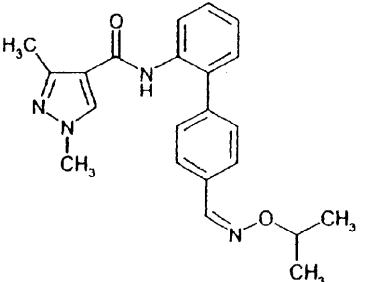
10

20

30

40



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

【 0 2 9 4 】

【 表 4 】

10

20

30

40

実施例番号		物理定数
15		
16		
17		logP 3.24 <sup>a)</sup>
18		融点 141-143°C
19		logP 5.10 <sup>a)</sup>

【 0 2 9 5 】

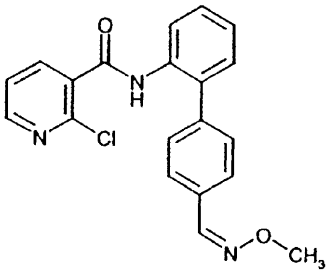
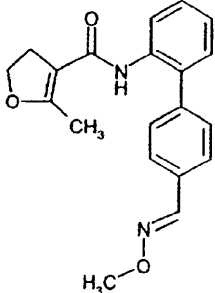
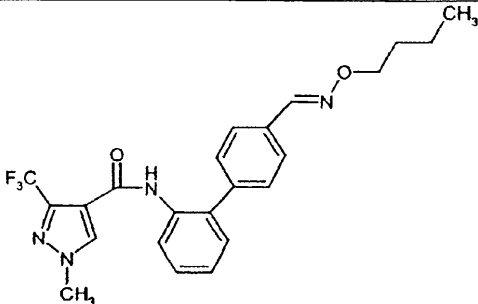
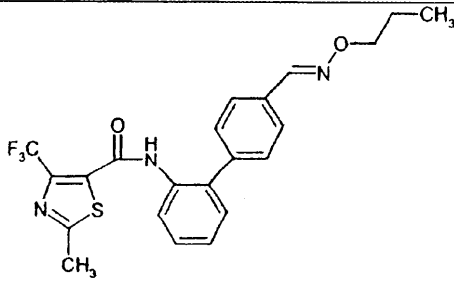
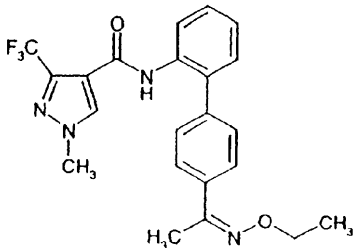
【 表 5 】

10

20

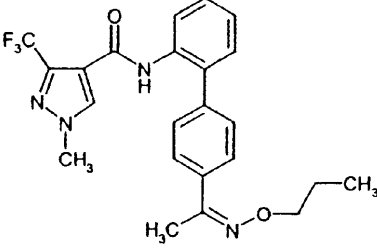
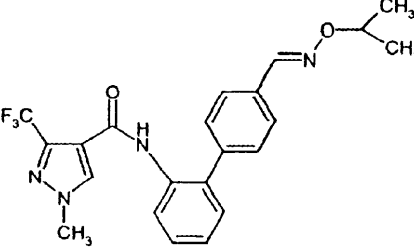
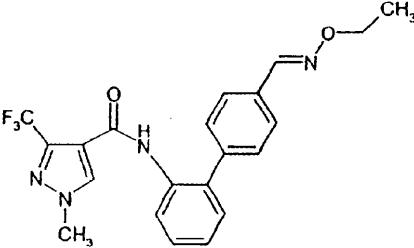
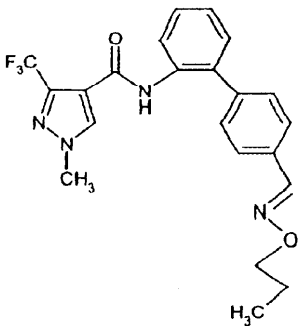
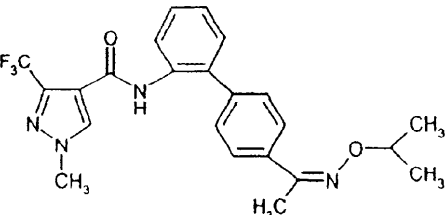
30

40

実施例番号		物理定数
20		融点 116-119°C
21		融点 144-147°C
22		logP 4.26 <sup>a)</sup>
23		logP 4.26 <sup>a)</sup>
24		融点 160-162°C

【 0 2 9 6 】

【 表 6 】

実施例番号		物理定数
25		融点148-150°C
26		融点126-128°C
27		融点170-172°C
28		logP 3.86 <sup>a)</sup>
29		融点164-166°C

【 0 2 9 7 】

【 表 7 】

10

20

30

40

实施例番号		物理定数
30		logP 2.78 <sup>a)</sup>
31		融点 89-91°C
32		logP 3.84 <sup>a)</sup>
33		logP 4.12 <sup>a)</sup>
34		logP 4.73 <sup>a)</sup>

【 0 2 9 8 】

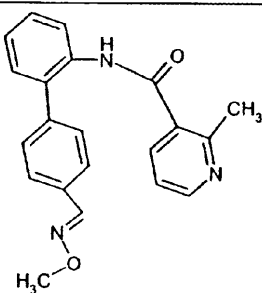
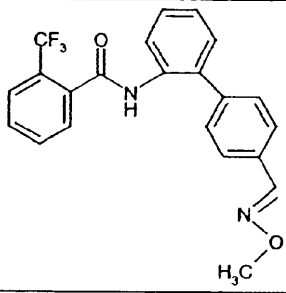
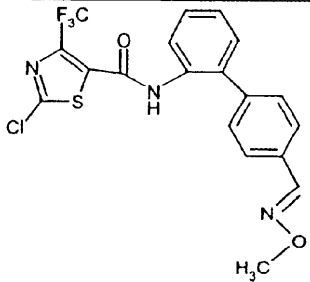
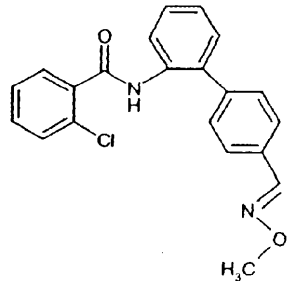
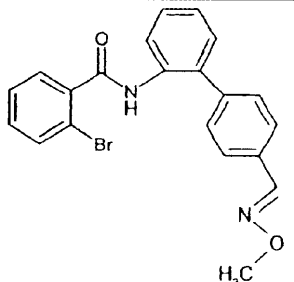
【 表 8 】

10

20

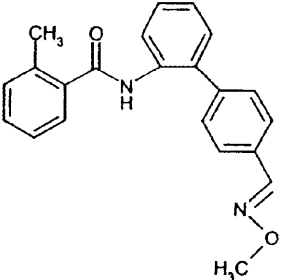
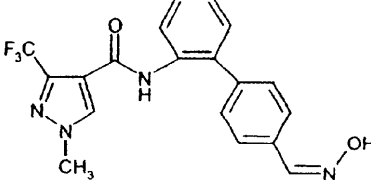
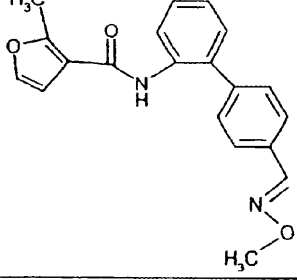
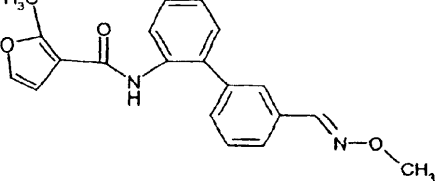
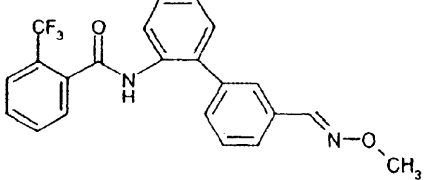
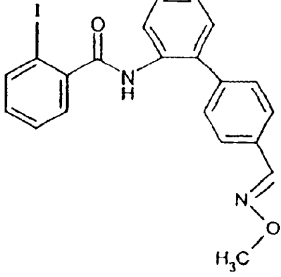
30

40

実施例番号		物理定数
35	 <chem>CO/N=C/c1ccc(cc1)-c2ccccc2NC(=O)c3ccccc3</chem>	logP 2.04 <sup>a)</sup>
36	 <chem>CO/N=C/c1ccc(cc1)-c2ccccc2NC(=O)c3ccccc3</chem>	logP 3.75 <sup>a)</sup>
37	 <chem>CO/N=C/c1ccc(cc1)-c2ccccc2NC(=O)c3ccccc3</chem>	logP 4.08 <sup>a)</sup>
38	 <chem>CO/N=C/c1ccc(cc1)-c2ccccc2NC(=O)c3ccccc3</chem>	logP 3.59 <sup>a)</sup>
39	 <chem>CO/N=C/c1ccc(cc1)-c2ccccc2NC(=O)c3ccccc3</chem>	logP 3.61 <sup>a)</sup>

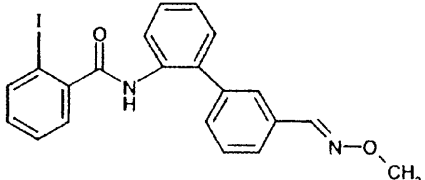
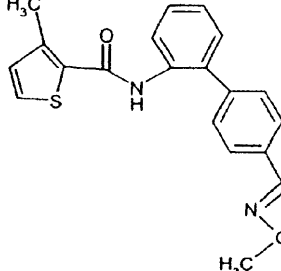
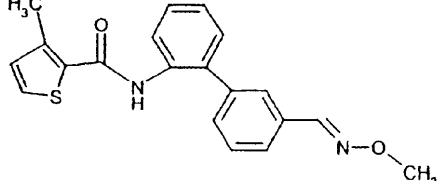
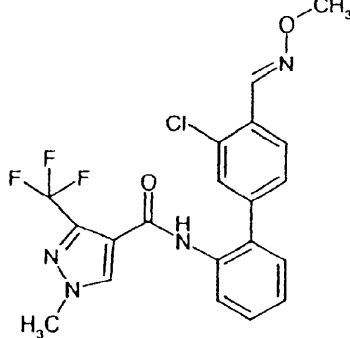
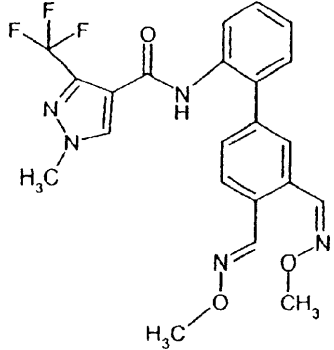
【 0 2 9 9 】

【 表 9 】

実施例番号		物理定数
40		logP 3.56 <sup>a)</sup>
41		logP 3.19 <sup>a)</sup>
42		logP 3.47 <sup>a)</sup>
43		logP 3.47 <sup>a)</sup>
44		logP 3.76 <sup>a)</sup>
45		logP 3.73 <sup>a)</sup>

【 0 3 0 0 】

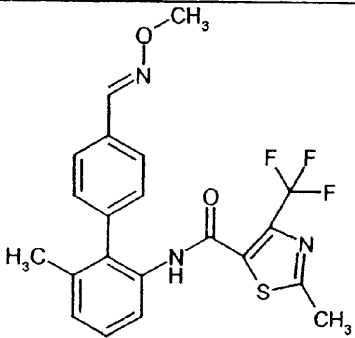
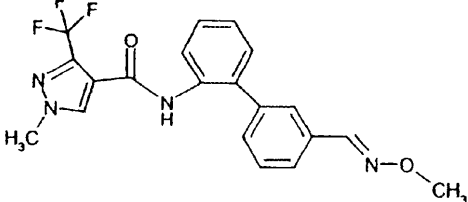
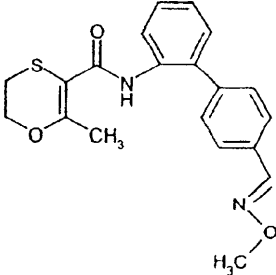
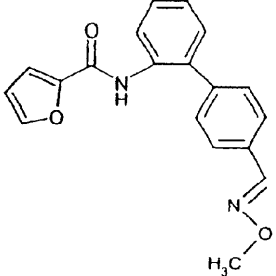
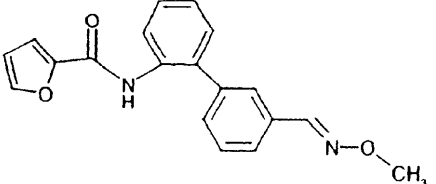
【 表 1 0 】

実施例番号		物理定数
46		logP 3.73 <sup>a)</sup>
47		logP 3.86 <sup>a)</sup>
48		logP 3.84 <sup>a)</sup>
49		logP 3.54 <sup>a)</sup>
50		logP 3.36 <sup>a)</sup>

【 0 3 0 1 】

【 表 1 1 】



実施例番号		物理定数
51		logP 3.78 <sup>a)</sup>
52		logP 3.25 <sup>a)</sup>
53		logP 3.75 <sup>a)</sup>
54		logP 3.20 <sup>a)</sup>
55		logP 3.20 <sup>a)</sup>

【 0 3 0 2 】

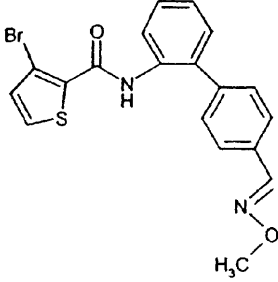
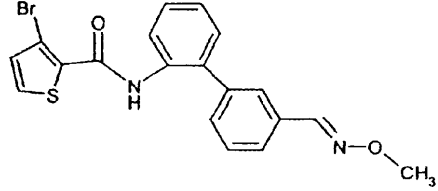
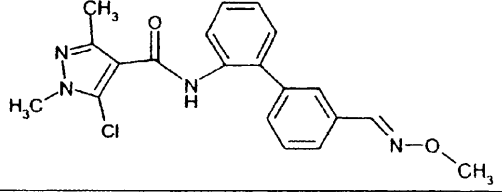
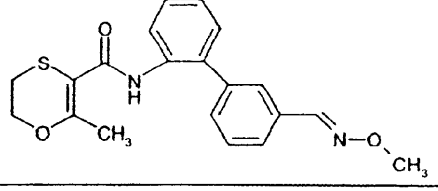
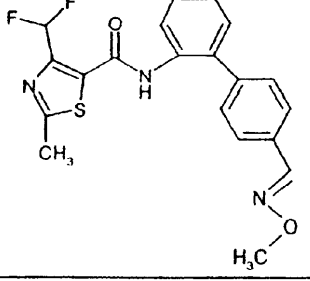
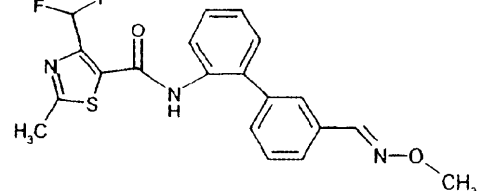
【 表 1 2 】

10

20

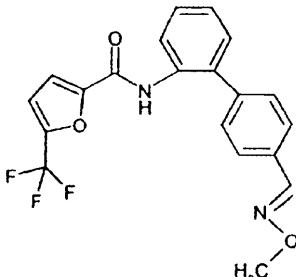
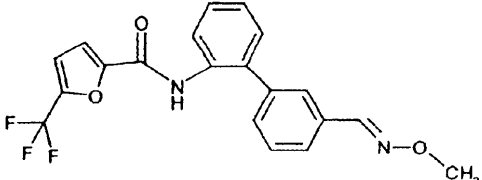
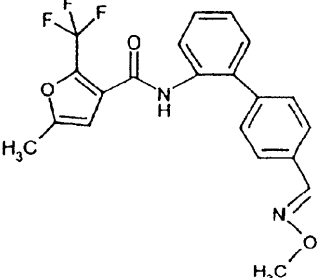
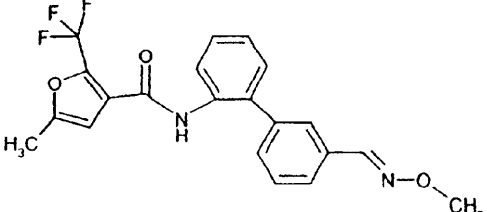
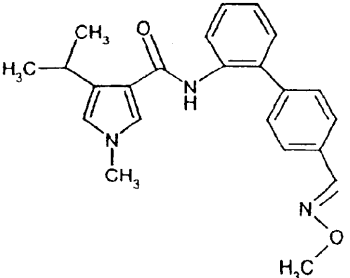
30

40

実施例番号		物理定数
56		logP 4.39 <sup>a)</sup>
57		logP 4.39 <sup>a)</sup>
58		logP 3.37 <sup>a)</sup>
59		logP 3.64 <sup>a)</sup>
60		logP 3.26 <sup>a)</sup>
61		logP 3.26 <sup>a)</sup>

【 0 3 0 3 】

【 表 1 3 】

実施例番号		物理定数
62		logP 3.99 <sup>a)</sup>
63		logP 4.02 <sup>a)</sup>
64		logP 3.94 <sup>a)</sup>
65		logP 3.97 <sup>a)</sup>
66		logP 3.82 <sup>a)</sup>

【 0 3 0 4 】

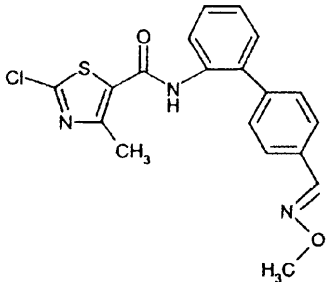
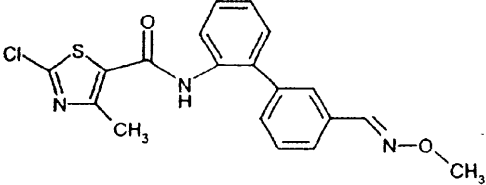
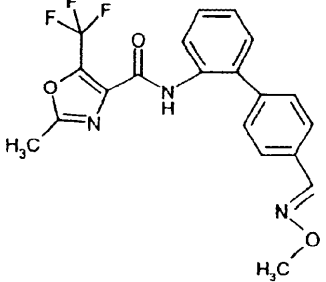
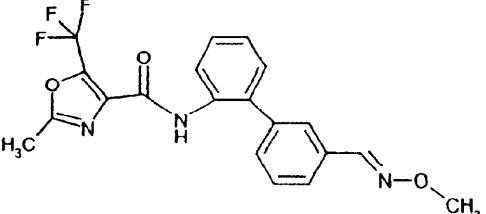
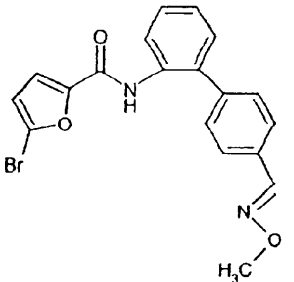
【 表 1 4 】

10

20

30

40

実施例番号		物理定数
67		logP 3.75 <sup>a)</sup>
68		logP 3.75 <sup>a)</sup>
69		logP 4.40 <sup>a)</sup>
70		logP 4.45 <sup>a)</sup>
71		logP 3.78 <sup>a)</sup>

【 0 3 0 5 】

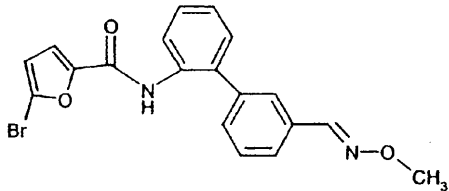
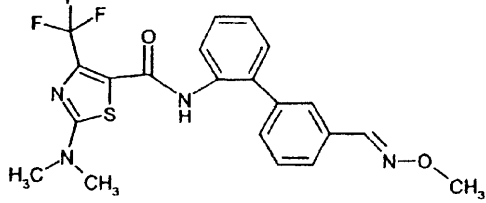
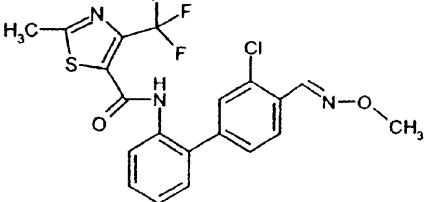
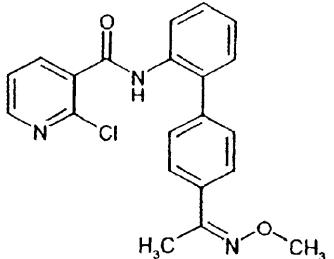
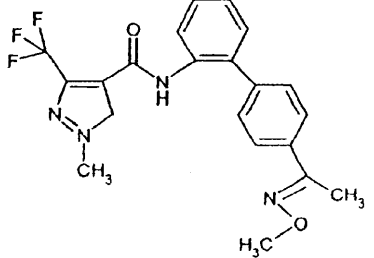
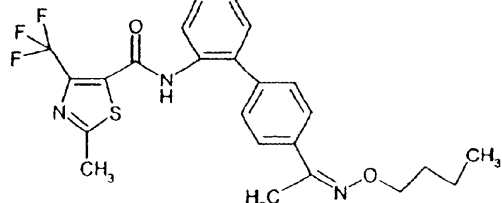
【 表 1 5 】

10

20

30

40

実施例番号		物理定数
72		logP 3.80 <sup>a)</sup>
73		logP 4.00 <sup>a)</sup>
74		logP 3.95 <sup>a)</sup>
75		融点129-131℃
76		融点157-158℃
77		logP 4.77 <sup>a)</sup>

【 0 3 0 6 】

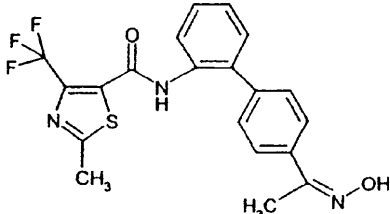
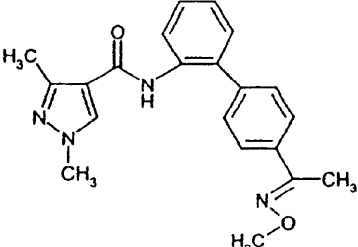
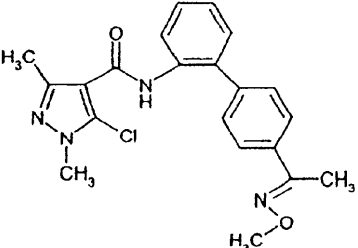
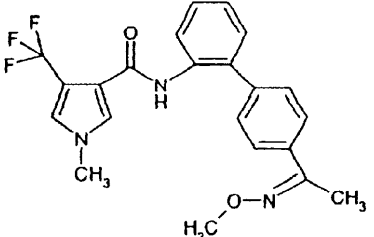
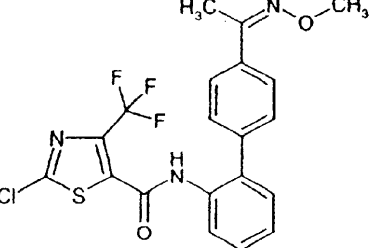
【 表 1 6 】

10

20

30

40

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

【 0 3 0 7 】

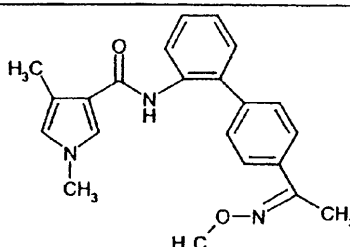
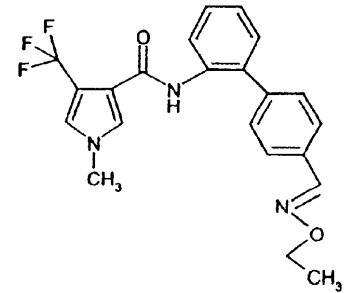
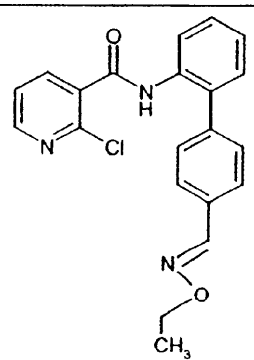
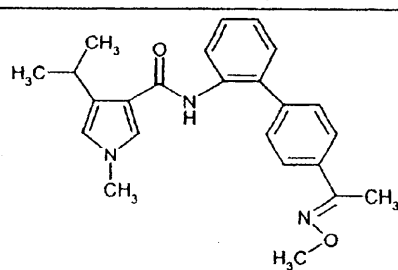
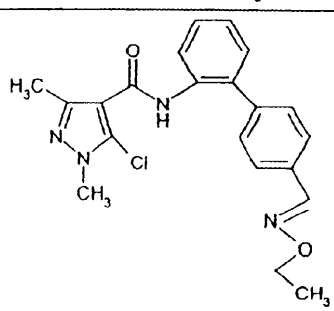
【 表 1 7 】

10

20

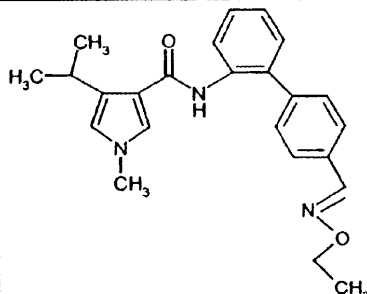
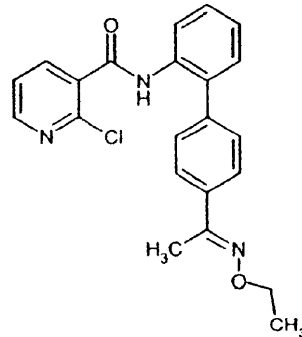
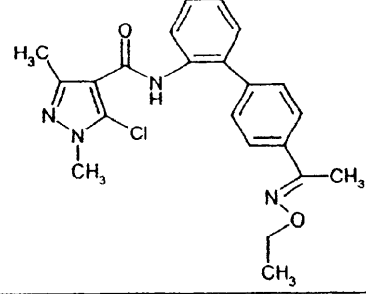
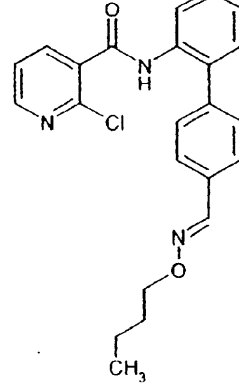
30

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

【 0 3 0 8 】

【 表 1 8 】

实施例番号		物理定数
88		融点 108-110°C
89		融点 119-121°C
90		融点 80-82°C
91		融点 68-70°C

【 0 3 0 9 】

【 表 1 9 】

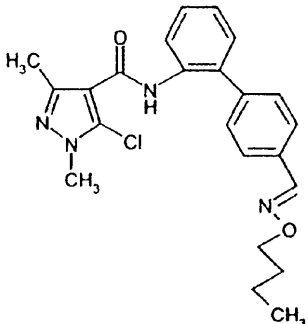
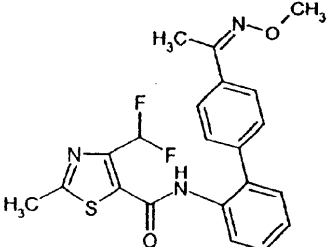
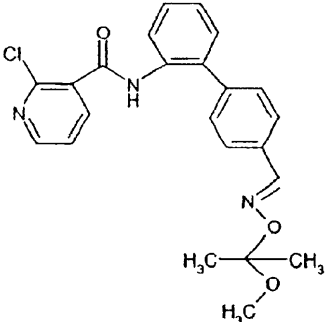
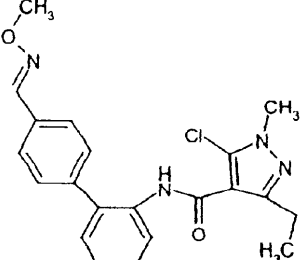
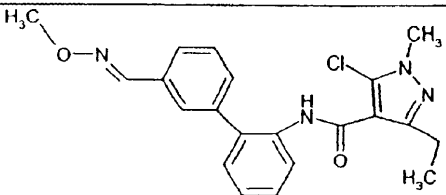
10

20

30

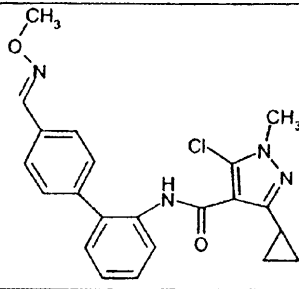
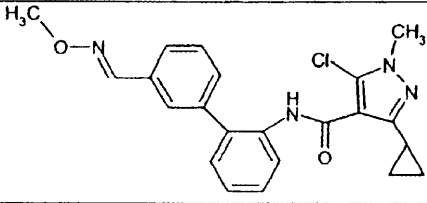
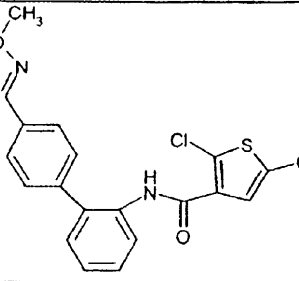
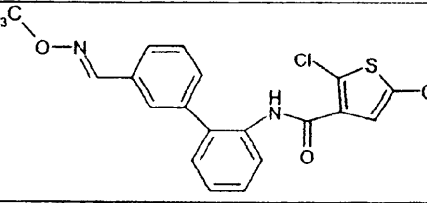
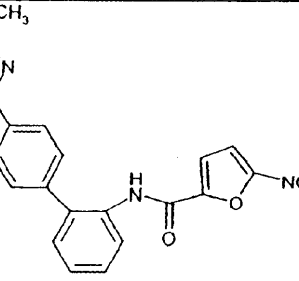
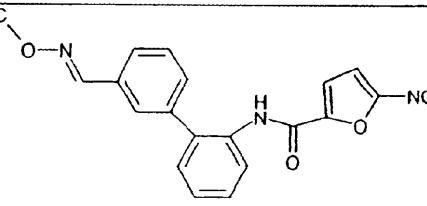
40



実施例番号		物理定数
92		融点 55-57°C
93		融点110-112°C
94		
95		logP 3.68 <sup>a)</sup>
96		logP 3.72 <sup>a)</sup>

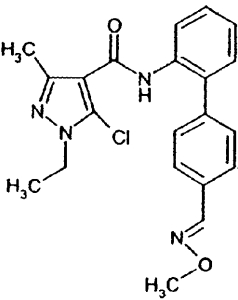
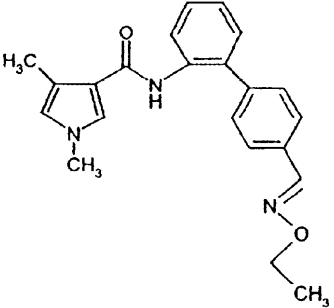
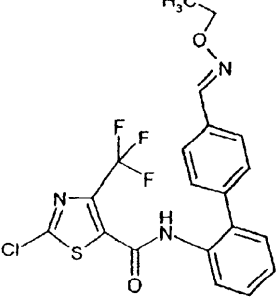
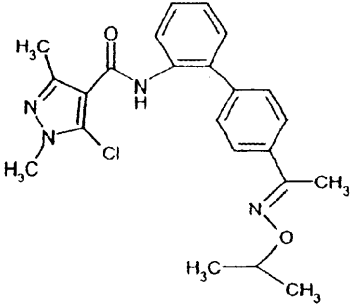
【 0 3 1 0 】

【表 20】

実施例番号		物理定数
97		logP 3.76 <sup>a)</sup>
98		logP 3.81 <sup>a)</sup>
99		logP 4.67 <sup>a)</sup>
100		logP 4.72 <sup>a)</sup>
101		logP 3.26 <sup>a)</sup>
102		logP 3.26 <sup>a)</sup>

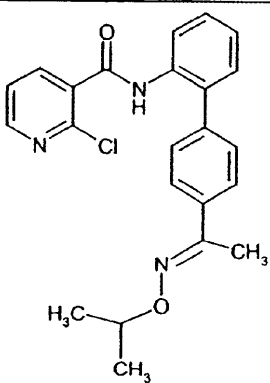
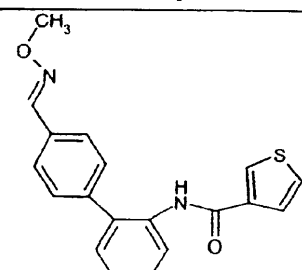
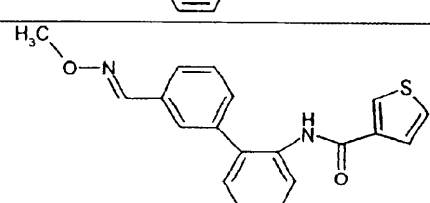
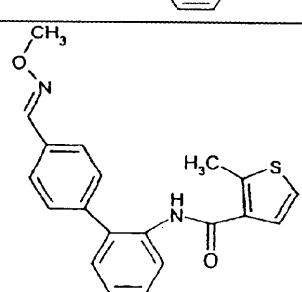
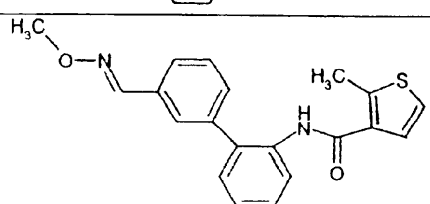
【 0 3 1 1 】

【 表 2 1 】

实施例番号		物理定数
103		logP 3.87 <sup>a)</sup>
104		融点 94-97°C
105		融点 103-105°C
106		融点 108-109°C

【 0 3 1 2 】

【 表 2 2 】

実施例番号		物理定数
107		融点 84-86°C
108		logP 3.10 <sup>a)</sup>
109		
110		logP 3.58 <sup>a)</sup>
111		logP 3.59 <sup>a)</sup>

【 0 3 1 3 】

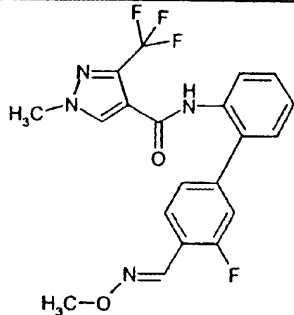
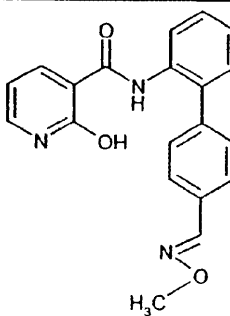
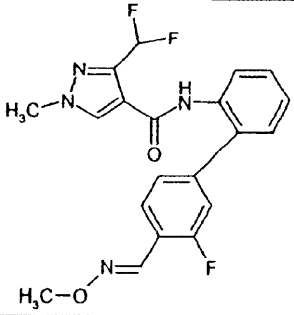
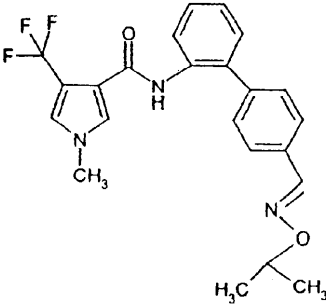
【 表 2 3 】

10

20

30

40

実施例番号		物理定数
112		logP 3.21 <sup>a)</sup>
113		logP 2.43 <sup>a)</sup>
114		logP 3.00 <sup>a)</sup>
115		融点157-159°C

【 0 3 1 4 】

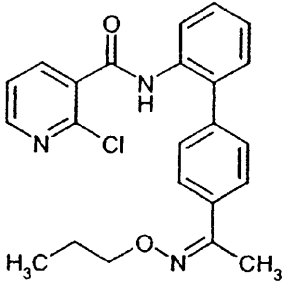
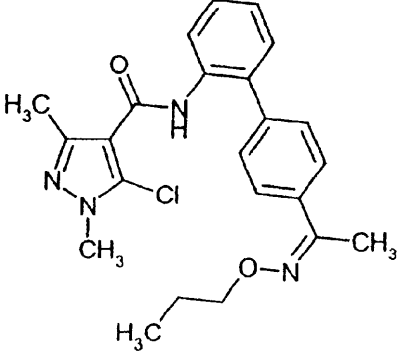
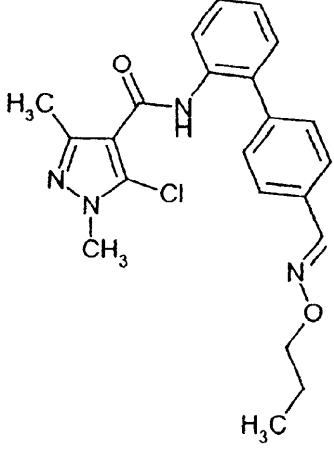
【 表 2 4 】

10

20

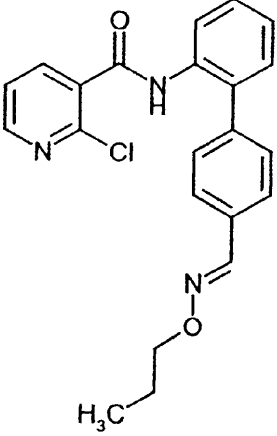
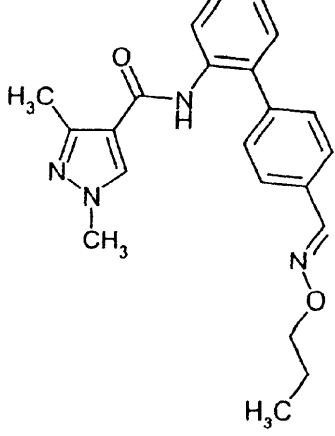
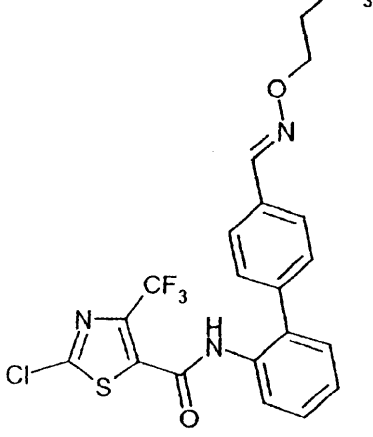
30

40

実施例番号		物理定数
116		融点 70-72°C
117		融点 75°C
118		logP 4.22 <sup>a)</sup>

【 0 3 1 5 】

【 表 2 5 】

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

## 【 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<sup>a)</sup>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

10

20

30

40

50

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<sup>b)</sup>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（*Podospheera leucotricha*）の水性孢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：

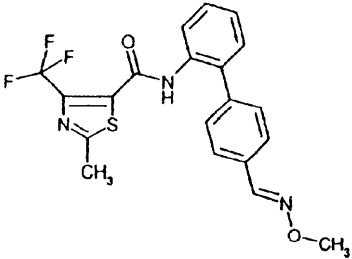
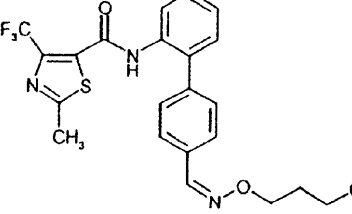
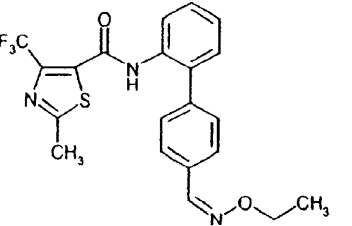
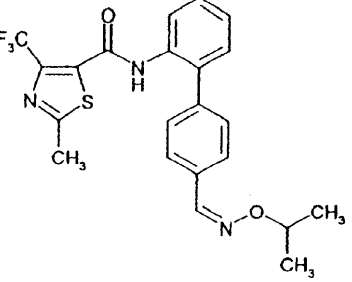
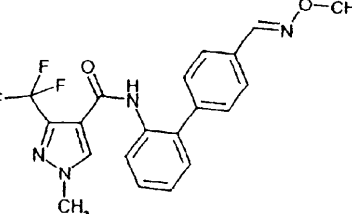
【０３２２】

30

【表２６】



表A: ホトスファエラ試験(リンゴ)/保護的

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

【 0 3 2 3 】

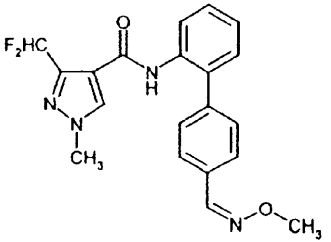
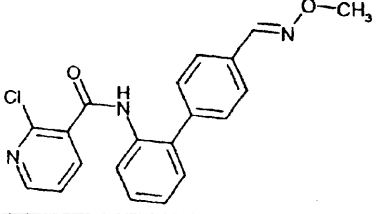
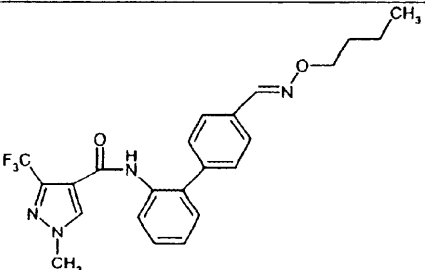
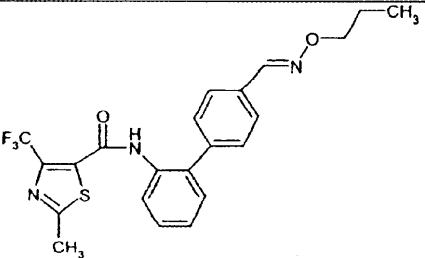
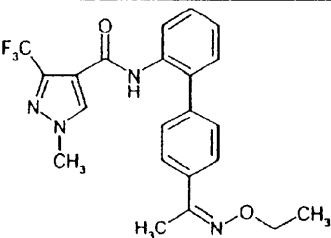
【 表 2 7 】

10

20

30

40

活性化化合物		g/ヘクタール における 活性化化合物の 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 】

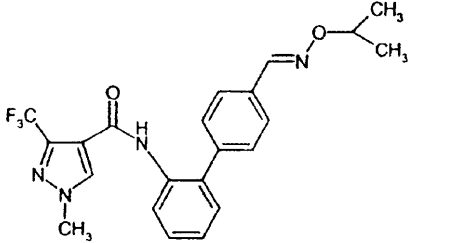
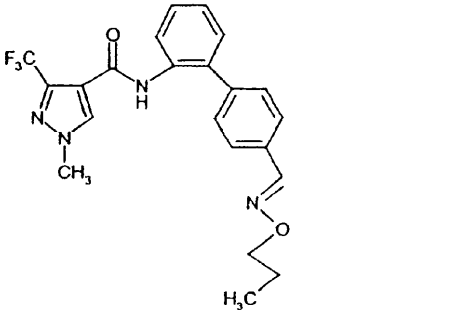
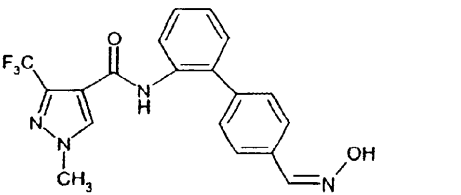
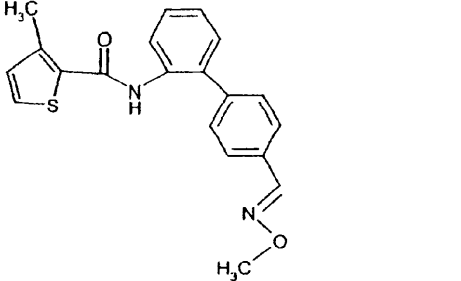
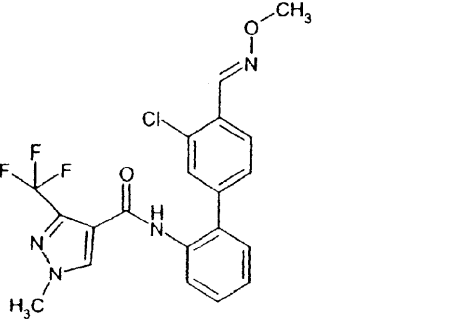
【 表 2 8 】

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
(I-28)		100	99
(I-41)		100	98
(I-47)		100	100
(I-49)		100	100

【 0 3 2 5 】

【 表 2 9 】

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

## 【 0 3 2 6 】

## 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

活性化化合物の適した調製物を作るために、1重量部の活性化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。

## 【 0 3 2 7 】

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・フリギネア（*Sphaerotheca fuliginea*）の水性孢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。

## 【 0 3 2 8 】

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。

## 【 0 3 2 9 】

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：

## 【 0 3 3 0 】

10

20

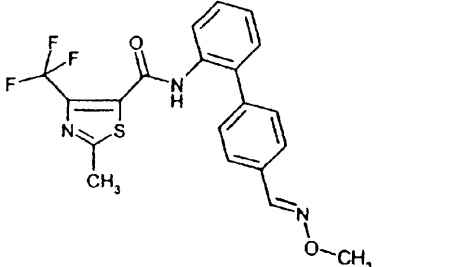
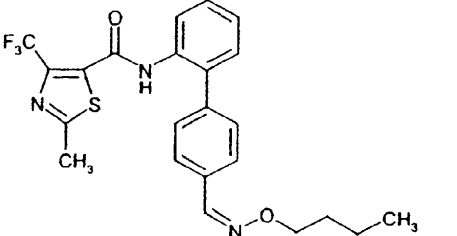
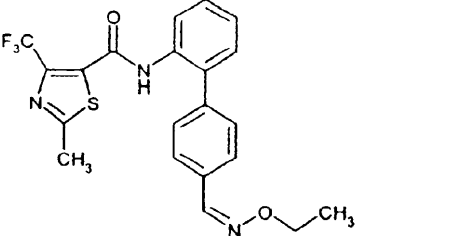
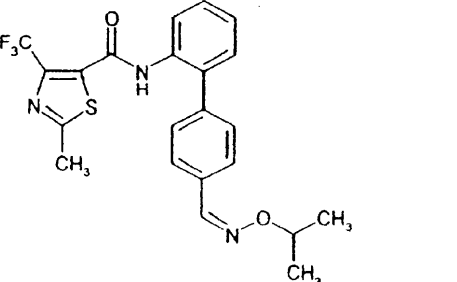
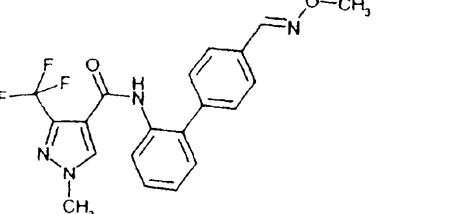
30

40

50

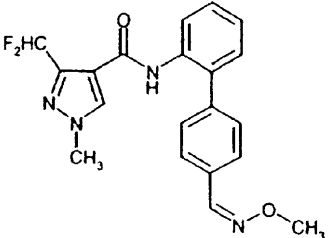
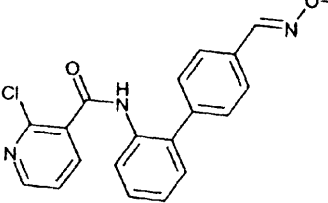
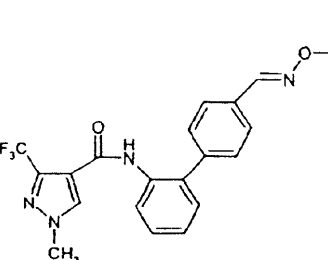
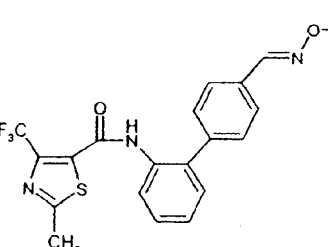
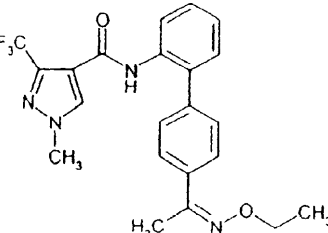
【表 3 0】

表B：スファエロテカ試験(キュウリ)/保護的

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

【 0 3 3 1 】

【表 3 1】

	活性化化合物	g/ヘクタール における 活性化化合物の 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 】

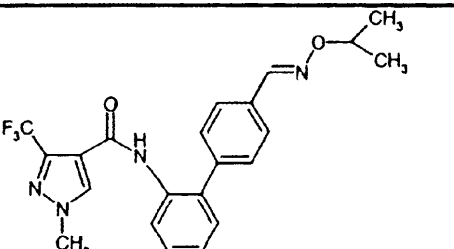
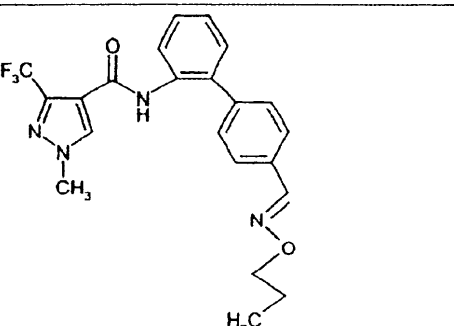
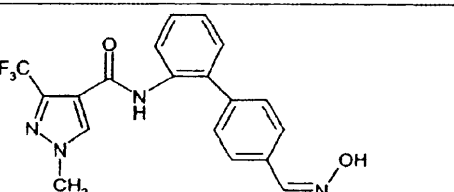
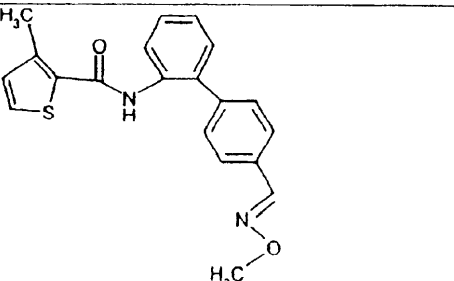
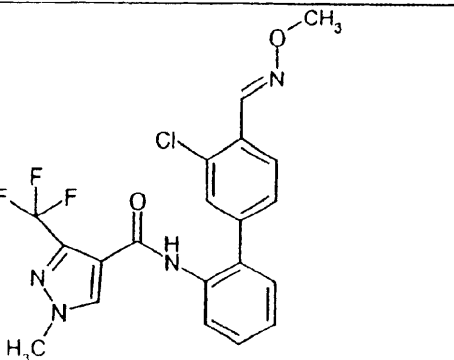
【 表 3 2 】

10

20

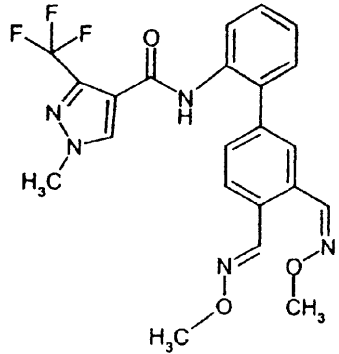
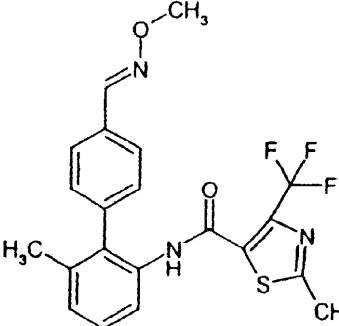
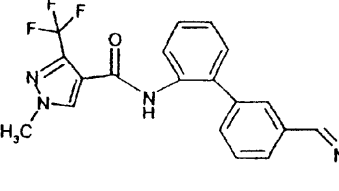
30

40

	活性化化合物	g/ヘクタール における 活性化化合物の 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 3 3 】

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

## 【 0 3 3 4 】

## 実施例 C

ベンチュリア試験（リンゴ）／保護的

溶媒： 2 4 . 5 重量部のアセトン

2 4 . 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

活性化化合物の適した調製物を作るために、 1 重量部の活性化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。

## 【 0 3 3 5 】

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 2 0 及び 1 0 0 % 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。

## 【 0 3 3 6 】

次いで植物を約 2 1 及び約 9 0 % の相対大気湿度において温室内に置く。

## 【 0 3 3 7 】

接種から 1 2 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、 1 0 0 % の有効性は感染が観察されないことを意味する。

## 【 0 3 3 8 】

10

20

30

40

50

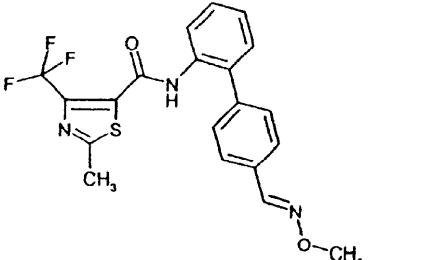
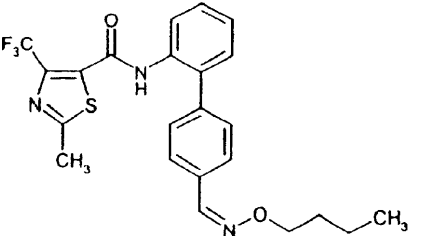
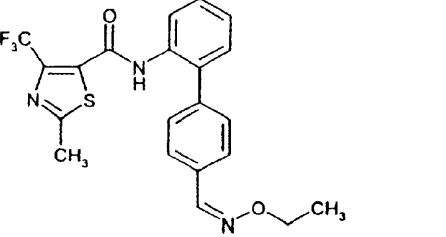
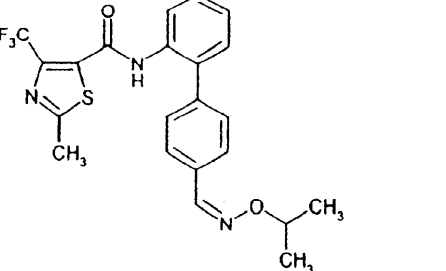
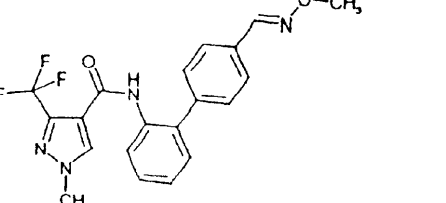


この試験で、例えば以下の製造実施例の本発明に従う化合物は、先行技術の活性より優れた活性を示す：

【 0 3 3 9 】

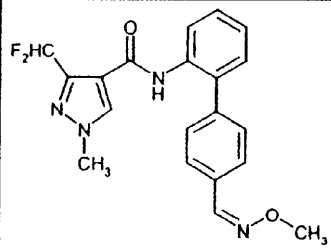
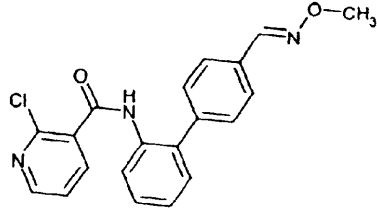
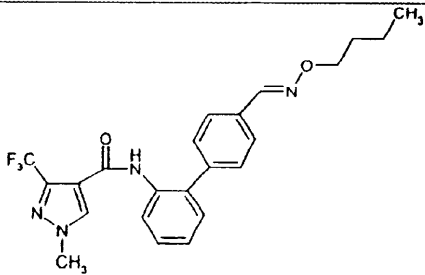
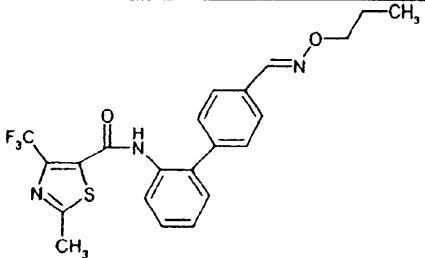
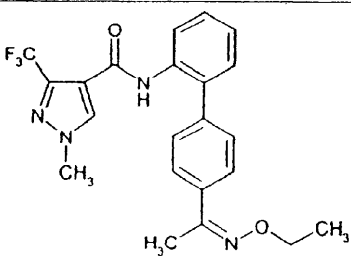
【 表 3 4 】

表C：ベンチリア試験(リンゴ)/保護的

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

【 0 3 4 0 】

【 表 3 5 】

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 】

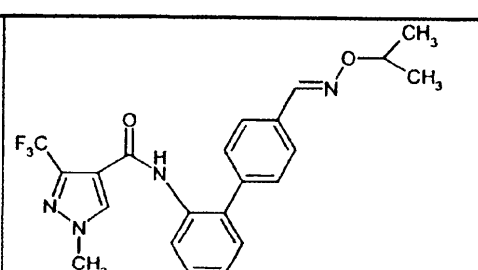
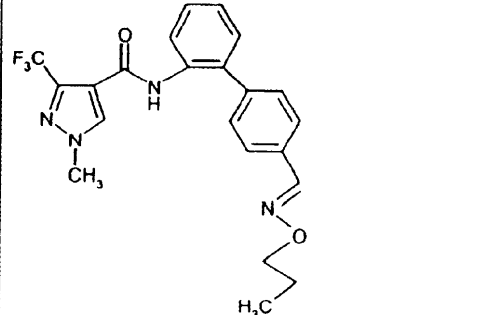
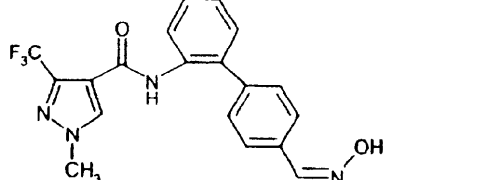
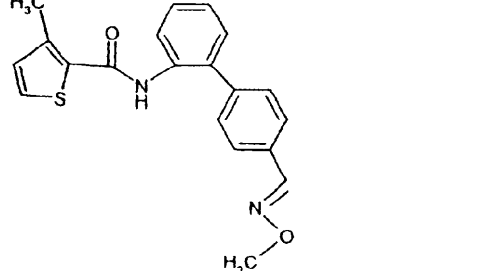
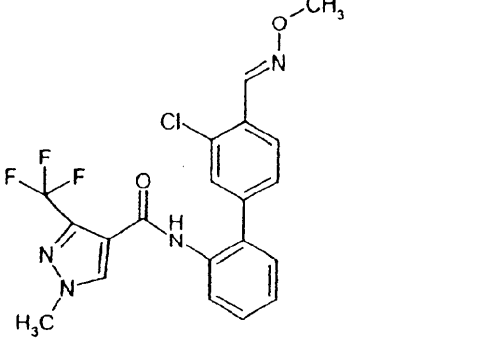
【 表 3 6 】

10

20

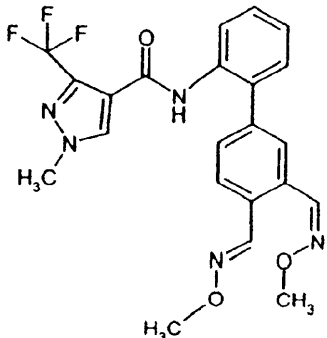
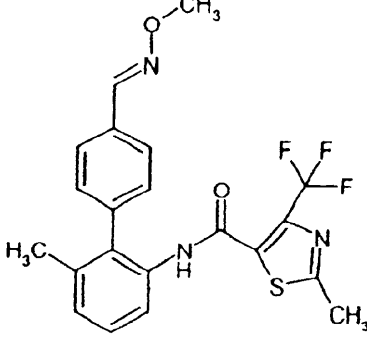
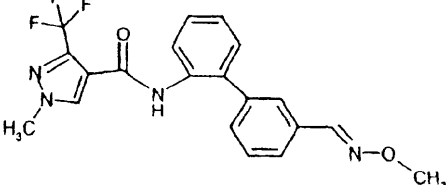
30

40

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

【 0 3 4 2 】

【 表 3 7 】

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

## 【 0 3 4 3 】

## 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

活性化化合物の適した調製物を作るために、1重量部の活性化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。

## 【 0 3 4 4 】

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。

## 【 0 3 4 5 】

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、サビ膿胞の発現を促進する。

## 【 0 3 4 6 】

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。

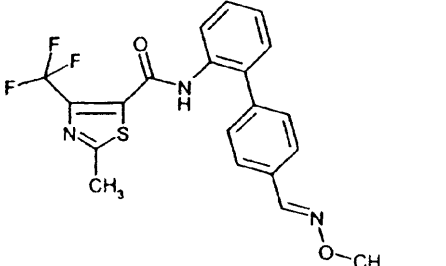
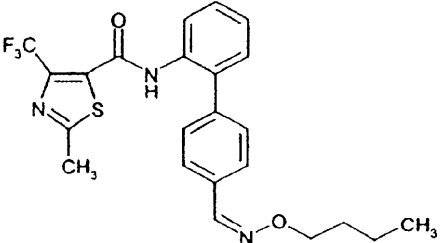
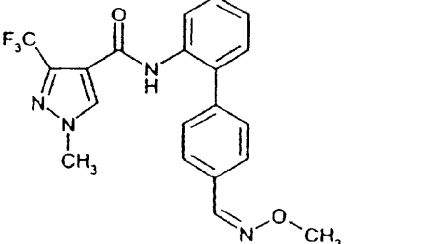
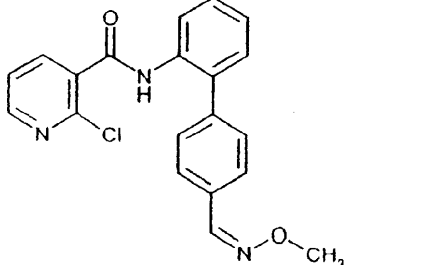
【 0 3 4 7 】

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：

【 0 3 4 8 】

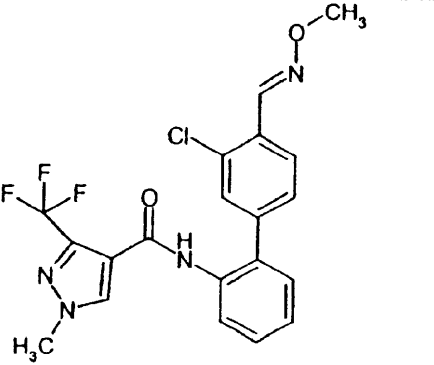
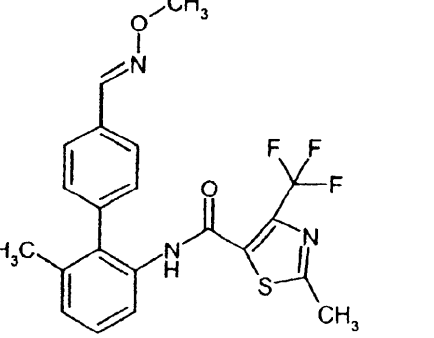
【表 3 8】

表D：フクニア試験(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
(I-3)		250	100
(I-10)		250	100
(I-20)		250	100

【 0 3 4 9 】

【表 3 9】

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

10

20

## 【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

活性化化合物の適した調製物を作るために、1重量部の活性化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。

30

## 【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*) の孢子懸濁液を接種し、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。

40

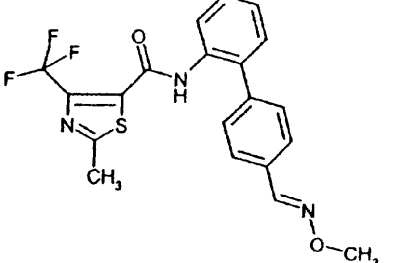
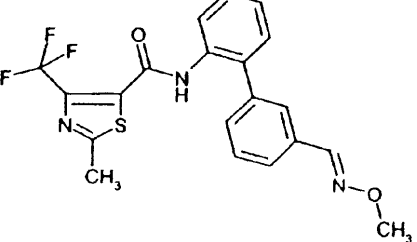
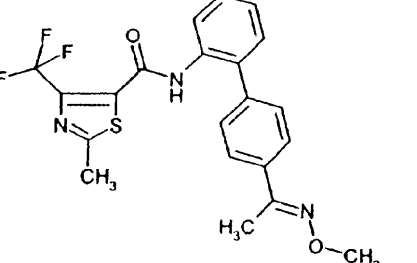
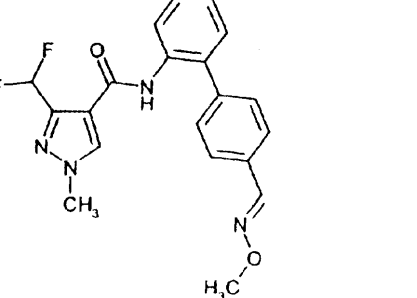
## 【0353】

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】

表E：アルテルナリア試験(トマト)/保護的

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

## 【 0 3 5 5 】

## 実施例 F

担子菌類の巨大コロニー上における阻害試験

グロエオフィラム・ツラベウム (*Gloeophyllum trabeum*)、コニオフォラ・プテアナ (*Coniophora puteana*)、ボリア・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・ベルシコロール (*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む寒天培地上で 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。

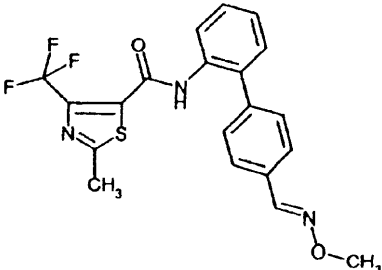
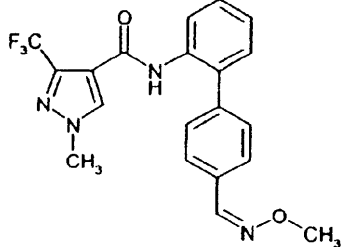
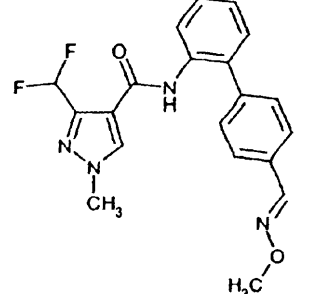
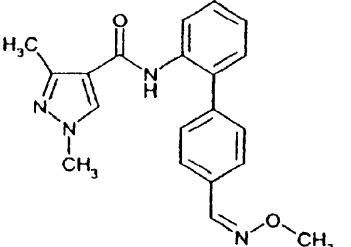
【 0 3 5 6 】

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：

【 0 3 5 7 】

【表 4 1】

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
(I-10)		6	100
(I-11)		6	100
(I-12)		6	100

10

20

30

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・クリンヤーシュトラッセ 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・オペ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・ノイエカンパーベーク 4 8

(72)発明者 クク, カール - ハイנטツ

ドイツ 4 0 7 6 4 ランゲンエルト・パストル - レー - シュトラッセ 3 0 アー

- (72)発明者 ククラー, マルティン  
ドイツ42799ライヒリンゲン・アムクロスター47
- (72)発明者 ヤエチユ, トマス  
ドイツ50670ケルン・イネレカナルシュトラッセ220

審査官 斉藤 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)