

(19) 日本国特許庁(IP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2006-526587

(P2006-526587A)

(43) 公表日 平成18年11月24日(2006.11.24)

(51) Int.Cl.		F I		テーマコード（参考）
C07D 487/04	(2006.01)	C07D 487/04	1 4 6	4C050
A01P 3/00	(2006.01)	C07D 487/04	C S P	4H011
A01N 43/90	(2006.01)	AO1P 3/00		
A01N 25/30	(2006.01)	AO1N 43/90	1 0 5	
		AO1N 25/30		

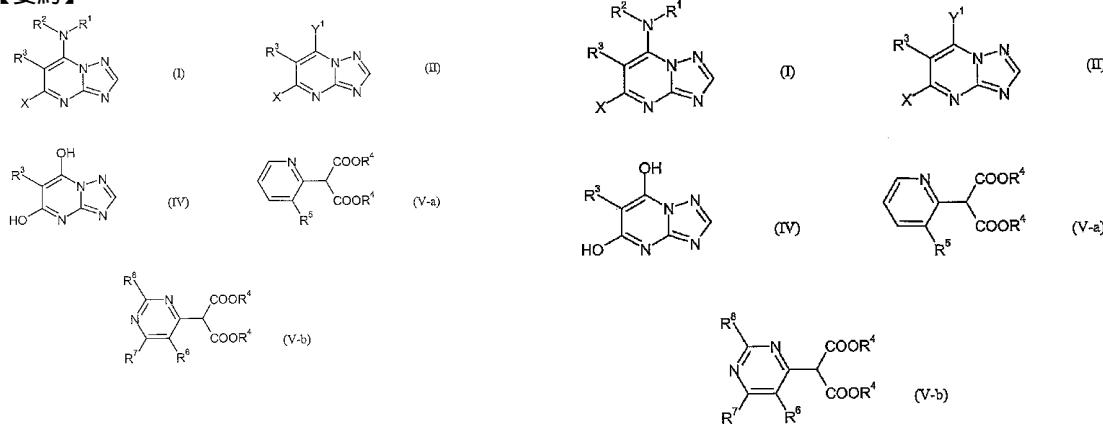
審查請求 未請求 予備審查請求 未請求 (全 49 頁)

(21) 出願番号	特願2006-508237 (P2006-508237)	(71) 出願人	302063961 バイエル・クロップサイエンス・アクチ ングゼルシャフト ドイツ40789モンハイム・アルフレ トーノベルーシュトラーセ50
(86) (22) 出願日	平成16年6月1日 (2004.6.1)		
(85) 翻訳文提出日	平成18年1月19日 (2006.1.19)		
(86) 國際出願番号	PCT/EP2004/005876		
(87) 國際公開番号	W02004/108727	(74) 代理人	100062007 弁理士 川口 義雄
(87) 國際公開日	平成16年12月16日 (2004.12.16)	(74) 代理人	100114188 弁理士 小野 誠
(31) 優先権主張番号	10325133.2	(74) 代理人	100119253 弁理士 金山 賢教
(32) 優先日	平成15年6月4日 (2003.6.4)	(74) 代理人	100103920 弁理士 大崎 勝真
(33) 優先権主張国	ドイツ (DE)	(74) 代理人	100124855 弁理士 坪倉 道明

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 トリアゾロピリミジン類

(57) 【要約】



本発明は、式(Ⅰ)

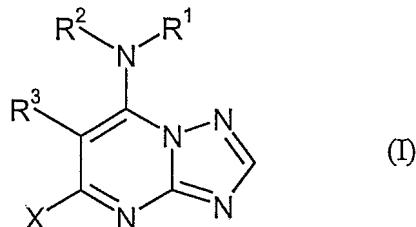
[式中、R¹、R²、R³及びXは、本明細書中に記載されている意味を有する]で表される新規トリアゾロピリミジン類、該物質を調製するための方法、及び、望ましくない微生物を防除するための該物質の使用に関する。本発明は、さらに、式(I I)、式(I V)、式(V-a)及び式(V-b)で表される新規中間体、並びに、該物質を調製するための方法にも関する。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式：

【化 1】



10

[式中、

R^1 は、場合により置換されていてもよいアルキル、場合により置換されていてもよいアルケニル、場合により置換されていてもよいアルキニル、場合により置換されていてもよいシクロアルキル、又は、場合により置換されていてもよいヘテロシクリルを表し；

R^2 は、水素又はアルキルを表すか；

又は

R^1 と R^2 は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、場合により置換されていてもよいヘテロ環を表し；

R^3 は、場合により置換されていてもよいピリジル、又は、場合により置換されていてもよいピリミジルを表し；

及び、

X は、ハロゲンを表す]

で表されるトリアゾロピリミジン。

【請求項 2】

R^1 が、1から6個の炭素原子を有するアルキル（ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、1から4個の炭素原子を有するアルコキシ、及び／又は、3から6個の炭素原子を有するシクロアルキルの、同種の置換基又は異種の置換基で、1から5回置換されることが可能である）を表すか；

又は、

R^1 が、2から6個の炭素原子を有するアルケニル（ここで、該アルケニルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、1から4個の炭素原子を有するアルコキシ、及び／又は、3から6個の炭素原子を有するシクロアルキルの、同種の置換基又は異種の置換基で、1から3回置換されることが可能である）を表すか；

又は、

R^1 が、3から6個の炭素原子を有するアルキニル（ここで、該アルキニルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、1から4個の炭素原子を有するアルコキシ、及び／又は、3から6個の炭素原子を有するシクロアルキルの、同種の置換基又は異種の置換基で、1から3回置換されることが可能である）を表すか；

又は、

R^1 が、1から6個の炭素原子を有するシクロアルキル（ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン、及び／又は、1から4個の炭素原子を有するアルキルの、同種の置換基又は異種の置換基で、1から3回置換されることが可能である）を表すか；

又は、

R^1 が、1から3個のヘテロ原子（例えば、窒素、酸素及び／又は硫黄）を有する5環員又は6環員の飽和又は不飽和のヘテロシクリル（ここで、該ヘテロシクリルは、ハロゲン、1から4個の炭素原子を有するアルキル、シアノ、及び／又は、3から6個の炭素原子を有するシクロアルキルで、1回又は2回置換されることが可能である）を表し；

R^2 が、水素、又は、1から4個の炭素原子を有するアルキルを表すか；

又は、

30

40

50

R^1 と R^2 が、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、3から6環員の飽和又は不飽和のヘテロ環（ここで、該ヘテロ環は、環員としてさらに窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を含むことが可能であり、また、該ヘテロ環は、フッ素、塩素、臭素、1から4個の炭素原子を有するアルキル、並びに / 又は、1から4個の炭素原子と1から9個のフッ素原子及び / 若しくは塩素原子を有するハロアルキルで、場合により、最大3回まで置換されることが可能である）を表し；

R^3 が、ピリジル（ここで、該ピリジルは、フッ素、塩素、臭素若しくはシアノ、又は、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシイミノアルキル若しくはアルコキシイミノアルキル（ここで、これらは、それぞれ、1から3個の炭素原子を有する）、又は、ハロアルキル若しくはハロアルコキシ（ここで、これらは、それぞれ、1から3個の炭素原子を有する）の、同種の置換基又は異種の置換基で、1から4回置換されることが可能である）を表すか；

10

又は、

R^3 が、ピリミジル（ここで、該ピリミジルは、フッ素、塩素、臭素若しくはシアノ、又は、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシイミノアルキル若しくはアルコキシイミノアルキル（ここで、これらは、それぞれ、1から3個の炭素原子を有する）、又は、ハロアルキル若しくはハロアルコキシ（ここで、これらは、それぞれ、1から3個の炭素原子及び1から7個のハロゲン原子を有する）の、同種の置換基又は異種の置換基で、1から3回置換されることが可能である）を表し；

20

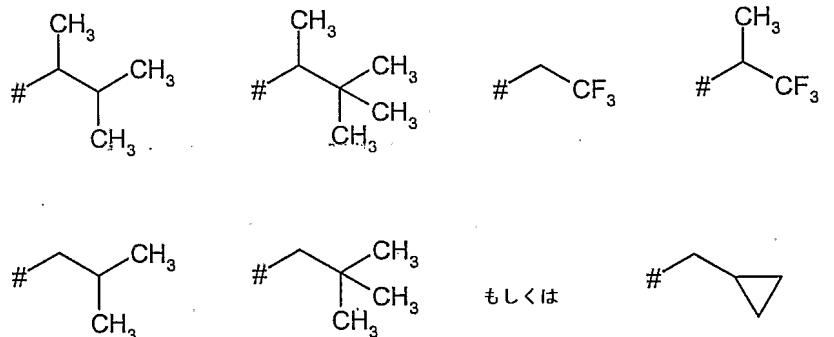
X が、フッ素、塩素又は臭素を表す；

請求項1に記載の式(I)で表されるトリアゾロピリミジン。

【請求項3】

R^1 が、下記式：

【化2】



30

[式中、#は、結合点を示している]

で表される残基を表すか；

又は、

R^1 が、アリル、ジクロロアリル、プロパルギル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシリル、ピペリジニル又はモルホリニルを表し；

40

R^2 が、水素、メチル又はエチルを表すか；

又は、

R^1 と R^2 が、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、ピロリジニル、ピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、3,6-ジヒドロ-1(2H)-ピペリジニル又はテトラヒドロ-1(2H)-ピリダジニル（ここで、これらの残基は、1から3個のフッ素原子、1から3個のメチル基及び / 又はトリフルオロメチルで置換されることが可能である）を表し；

R^3 が、ピリジル（ここで、該ピリジルは、2位又は4位で結合しており、また、該ピリジルは、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、メトキシ、メチルチオ、ヒドロキシイミノメチル、ヒドロキシイミノエチル、メトキシイミノメチル、メトキシイミノエチル及び / 又はトリフルオロメチルの、同種の置換基又は異種の置換基で、1から4回

50

置換されることが可能である)を表すか;

又は、

R^3 が、ピリミジル(ここで、該ピリミジルは、4位で結合しており、また、該ピリミジルは、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、メトキシ、メチルチオ、ヒドロキシイミノメチル、ヒドロキシイミノエチル、メトキシイミノメチル、メトキシイミノエチル及び/又はトリフルオロメチルの、同種の置換基又は異種の置換基で、1から3回置換されることが可能である)を表し;

X が、フッ素又は塩素を表す;

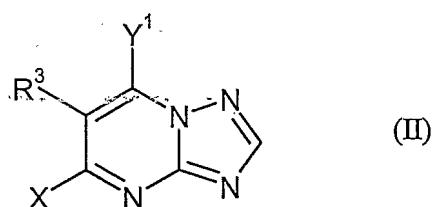
請求項1又は請求項2に記載の式(I)で表されるトリアゾロピリミジン。

【請求項4】

請求項1から3の1項以上に記載の式(I)で表されるトリアゾロピリミジンを調製する方法であって、

(a) 下記式:

【化3】



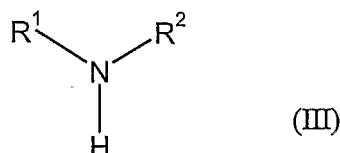
10

20

[式中、 R^3 及び X は上記意味を有し、 Y^1 はハロゲンを表す]

で表されるジハロゲントリアゾロピリミジンを、場合により希釀剤の存在下、場合により酸受容体の存在下、及び、場合により触媒の存在下で、下記式:

【化4】



30

[式中、 R^1 及び R^2 は、上記意味を有する]

で表されるアミンと反応させることを特徴とする、前記方法。

【請求項5】

望ましくない微生物を防除する手段であって、請求項1から3の1項以上に記載の式(I)で表される少なくとも1種のトリアゾロピリミジンに加えて増量剤及び/又は界面活性剤を含んでいることを特徴とする、前記手段。

【請求項6】

望ましくない微生物を防除するための、請求項1から3の1項以上に記載の式(I)で表されるトリアゾロピリミジンの使用。

【請求項7】

望ましくない微生物を防除する方法であって、該望ましくない微生物及び/又はそれらの生息環境に、請求項1から3の1項以上に記載の式(I)で表されるトリアゾロピリミジンを施用することを特徴とする、前記方法。

【請求項8】

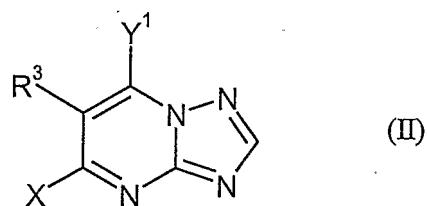
望ましくない微生物を防除するための手段を調製する方法であって、請求項1から3の1項以上に記載の式(I)で表されるトリアゾロピリミジンを増量剤及び/又は界面活性剤と混合することを特徴とする、前記方法。

【請求項9】

下記式:

40

【化5】



[式中、

R^3 は、場合により置換されていてもよいピリジル、又は、場合により置換されていてもよいピリミジルを表す；

X は、ハロゲンを表す；

Y^1 は、ハロゲンを表す]

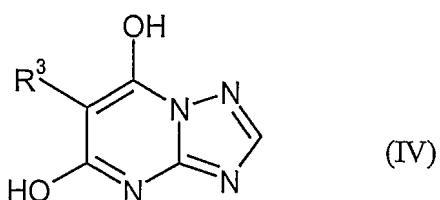
で表されるジハロゲン-トリアゾロピリミジン。

【請求項10】

請求項9に記載の式(II)で表されるジハロゲン-トリアゾロピリミジンを調製する方法であって、

(b) 下記式：

【化6】

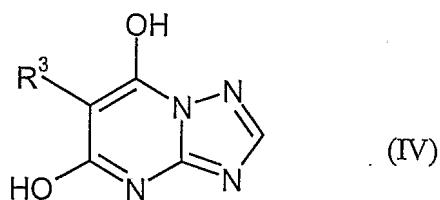
[式中、 R^3 は、請求項9に記載の意味を有する]

で表されるジヒドロキシ-トリアゾロ-ピリミジンを、場合により希釀剤の存在下で、ハロゲン化剤と反応させることを特徴とする、前記方法。

【請求項11】

下記式：

【化7】

[式中、 R^3 は、場合により置換されていてもよいピリジル、又は、場合により置換されていてもよいピリミジルを表す]

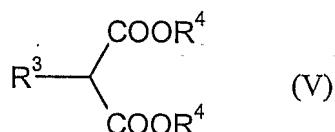
で表されるジヒドロキシ-トリアゾロ-ピリミジン。

【請求項12】

請求項11に記載の式(IV)で表されるジヒドロキシ-トリアゾロ-ピリミジンを調製する方法であって、

(c) 下記式：

【化8】



10

20

30

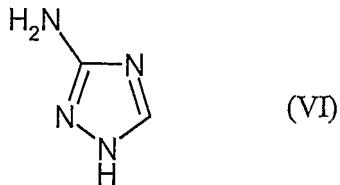
40

50

[式中、R³は請求項11に記載の意味を有し、R⁴は1から4個の炭素原子を有するアルキルを表す]

で表されるヘテロアリールマロン酸エステルを、場合により希釀剤の存在下、及び、場合により酸結合剤の存在下で、下記式：

【化9】



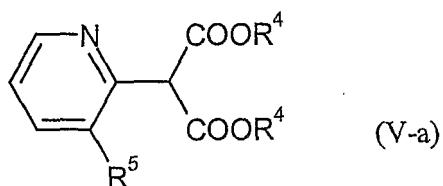
10

で表されるアミノトリアゾールと反応させることを特徴とする、前記方法。

【請求項13】

下記式：

【化10】



20

[式中、

R⁴は、1から4個の炭素原子を有するアルキルを表し；

R⁵は、ハロゲン又はハロアルキルを表す]

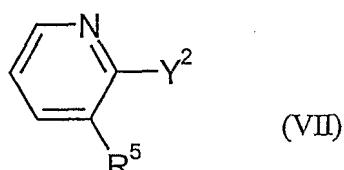
で表されるピリジルマロン酸エステル。

【請求項14】

請求項13に記載の式(V-a)で表されるピリジルマロン酸エステルを調製する方法であって、

(d) 下記式：

【化11】

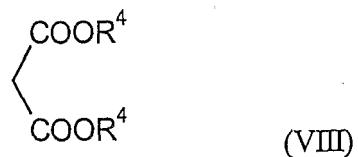


30

[式中、R⁵は請求項13に記載の意味を有し、Y²はハロゲンを表す]

で表されるハロゲン化ピリジンを、場合により希釀剤の存在下、場合により銅塩の存在下、及び、場合により酸受容体の存在下で、下記式：

【化12】



40

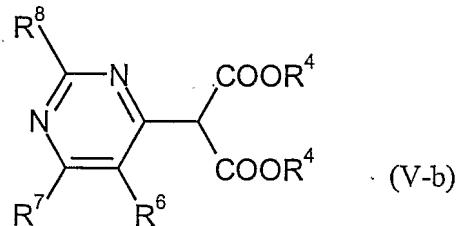
[式中、R⁴は請求項13に記載の意味を有する]

で表されるマロン酸エステルと反応させることを特徴とする、前記方法。

【請求項15】

下記式：

【化13】



[式中、

 R^4 は、1~4個の炭素原子を有するアルキルを表し；

10

 R^6 は、ハロゲン又はハロアルキルを表し； R^7 及び R^8 は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル又はメトキシを表す]

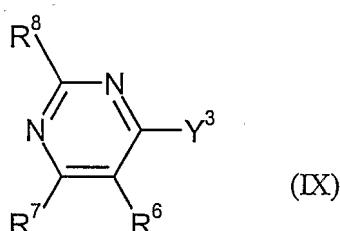
で表されるピリミジルマロン酸エステル。

【請求項16】

請求項15に記載の式(V-b)で表されるピリミジルマロン酸エステルを調製する方法であって、

(e) 下記式：

【化14】

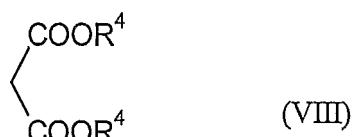


20

[式中、 R^6 、 R^7 及び R^8 は請求項15に記載の意味を有し、 Y^3 はハロゲンを表す]で表されるハロゲン化ピリミジンを、場合により希釀剤の存在下、場合により銅塩の存在下、及び、場合により酸受容体の存在下で、下記式：

【化15】

30

[式中、 R^4 は請求項15に記載の意味を有する]

で表されるマロン酸エステルと反応させることを特徴とする、前記方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

40

本発明は、新規トリアゾロピリミジン類、それらの調製方法、及び、望ましくない微生物を防除するためのそれらの使用に関する。本発明は、さらに、新規中間体生成物及びそれらの調製方法にも関する。

【背景技術】

【0002】

特定のトリアゾロピリミジン類が殺菌特性を有していることは既に知られている(C f . E P 0 5 5 0 1 1 3 - A、W O 9 4 - 2 0 5 0 1、E P 0 6 1 3 9 0 0 - A、U S 5 6 1 2 3 4 5 - A、E P 0 8 3 4 5 1 3 - A、W O 9 8 - 4 6 6 0 7、及び、W O 9 8 - 4 6 6 0 8)。これらの物質の効力は良好であるが、場合によっては、低い薬量で使用された場合に充分ではない。

50

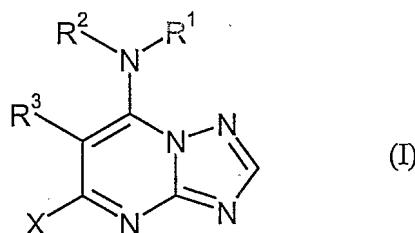
【発明の開示】

【0003】

下記式：

【0004】

【化16】



[式中、

R^1 は、場合により置換されていてもよいアルキル、場合により置換されていてもよいアルケニル、場合により置換されていてもよいアルキニル、場合により置換されていてもよいシクロアルキル、又は、場合により置換されていてもよいヘテロシクリルを表し；

R^2 は、水素又はアルキルを表すか；

又は

R^1 と R^2 は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、場合により置換されていてもよいヘテロ環を表し；

R^3 は、場合により置換されていてもよいピリジル、又は、場合により置換されていてもよいピリミジルを表し；

及び、

X は、ハロゲンを表す]

で表される新規トリアゾロピリミジン類が見いだされた。

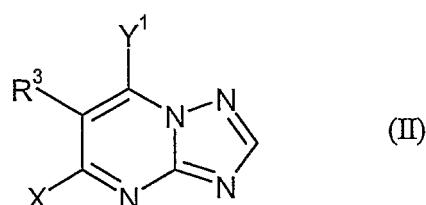
【0005】

さらに、

(a) 下記式：

【0006】

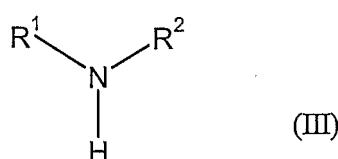
【化17】

[式中、 R^3 及び X は上記意味を有し、 Y^1 はハロゲンを表す]

で表されるジハロゲントリアゾロピリミジンを、場合により希釀剤の存在下、場合により酸受容体の存在下、及び、場合により触媒の存在下で、下記式：

【0007】

【化18】

[式中、 R^1 及び R^2 は、上記意味を有する]

50

で表されるアミンと反応させることにより式(Ⅰ)で表されるトリアゾロピリミジンを調製することができる事が見いだされた。

【0008】

最後に、式(Ⅰ)で表されるトリアゾロピリミジンが望ましくない微生物を防除するのに極めて適している事が見いだされた。式(Ⅰ)で表されるトリアゾロピリミジンは、第一に強い殺菌効果を示し、植物の保護及び材料物質(materials)の保護のいずれにおいても使用することができる。

【0009】

驚くべきことに、式(Ⅰ)で表されるトリアゾロピリミジンは、同じ作用標的を有する最も類似した構造の既に知られている物質と比べて、非常に優れた殺菌活性を有している。
10。

【0010】

本発明の式(Ⅰ)で表される化合物は、場合により、存在し得る種々の異性体形態の混合物として、特に、立体異性体(例えば、E異性体、Z異性体、トレオ異性体及びエリトロ異性体)や光学異性体(例えば、R異性体及びS異性体)又はアトロブ異性体の混合物として存在することが可能であり、さらにまた、場合により、互変異性体として存在することも可能である。

【0011】

本明細書において、一般に、式(Ⅰ)で表される化合物としてのみ言及されていたとしても、純粋な立体異性体と、さらにまた、そのような異性体の任意の混合物のいずれも、本発明の主題である。
20

【0012】

上記で定義されている置換基のタイプに応じて、式(Ⅰ)で表される化合物は、酸特性又は塩基特性を有し、塩を形成することができる。式(Ⅰ)の化合物が、ヒドロキシ基若しくはカルボキシ基を有するか、又は、酸特性を誘発する別の基を有する場合、そのような化合物は、塩基と反応させて塩を形成させ得る。適切な塩基は、例えば、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の水酸化物、炭酸塩及び炭酸水素塩、特に、ナトリウム、カリウム、マグネシウム及びカルシウムの水酸化物、炭酸塩及び炭酸水素塩であり、さらに、アンモニア、(C₁ ~ C₄)アルキル残基を有する第一級アミン、第二級及び第三級アミン、並びに、(C₁ ~ C₄)アルカノールのモノアルカノールアミン、ジアルカノールアミン及びトリアルカノールアミンも適している。式(Ⅰ)で表される化合物が、アミノ基若しくはアルキルアミノ基を有しているか、又は、塩基特性を誘発する別の基を有する場合、そのような化合物は、酸と反応させて塩を形成させ得る。適切な酸は、例えば、鉛酸(例えば、塩酸、硫酸銅及びリン酸)、有機酸(例えば、酢酸又はシュウ酸)及び酸性塩(例えば、NaHSO₄及びKHSO₄)である。このようにして得られた塩も、同様に、殺菌特性及び殺微生物特性を示す。
30

【0013】

さらにまた、本発明の主題には、塩基性化合物又は酸性化合物と反応させることにより式(Ⅰ)の化合物から形成させた塩様誘導体や、慣習的な酸素化法により調製可能なN-オキシドも含まれる。
40

【0014】

本発明のトリアゾロピリミジンは、一般に、式(Ⅰ)により定義される。式(Ⅰ)で表される好ましい物質においては、

R¹は、1~6個の炭素原子を有するアルキル(ここで、該アルキルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、1~4個の炭素原子を有するアルコキシ、及び/又は、3~6個の炭素原子を有するシクロアルキルの、同種の置換基又は異種の置換基で、1~5回置換されることが可能である)を表すか;

又は、

R¹は、2~6個の炭素原子を有するアルケニル(ここで、該アルケニルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、1~4個の炭素原子を有するアルコキシ、及び/又は、3~6個
50

の炭素原子を有するシクロアルキルの、同種の置換基又は異種の置換基で、1～3回置換されることが可能である)を表すか;

又は、

R¹は、3～6個の炭素原子を有するアルキニル(ここで、該アルキニルは、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、1～4個の炭素原子を有するアルコキシ、及び/又は、3～6個の炭素原子を有するシクロアルキルの、同種の置換基又は異種の置換基で、1～3回置換されることが可能である)を表すか;

又は、

R¹は、1～6個の炭素原子を有するシクロアルキル(ここで、該シクロアルキルは、ハロゲン、及び/又は、1～4個の炭素原子を有するアルキルの、同種の置換基又は異種の置換基で、1～3回置換されることが可能である)を表すか; 10

又は、

R¹は、1～3個のヘテロ原子(例えば、窒素、酸素及び/又は硫黄)を有する5環員又は6環員の飽和又は不飽和のヘテロシクリル(ここで、該ヘテロシクリルは、ハロゲン、1～4個の炭素原子を有するアルキル、シアノ、及び/又は、3～6個の炭素原子を有するシクロアルキルで、1回又は2回置換されることが可能である)を表し;

R²は、水素、又は、1～4個の炭素原子を有するアルキルを表すか;

又は、

R¹とR²は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、3～6環員の飽和又は不飽和のヘテロ環(ここで、該ヘテロ環は、環員としてさらに窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を含むことが可能であり、また、該ヘテロ環は、フッ素、塩素、臭素、1～4個の炭素原子を有するアルキル、並びに/又は、1～4個の炭素原子と1～9個のフッ素原子及び/若しくは塩素原子を有するハロアルキルで、場合により、最大3回まで置換されることが可能である)を表し; 20

R³は、ピリジル(ここで、該ピリジルは、フッ素、塩素、臭素若しくはシアノ、又は、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシイミノアルキル若しくはアルコキシイミノアルキル(ここで、これらは、それぞれ、1～3個の炭素原子を有する)、又は、ハロアルキル若しくはハロアルコキシ(ここで、これらは、それぞれ、1～3個の炭素原子を有する)の、同種の置換基又は異種の置換基で、1～4回置換されることが可能である)を表すか; 30
又は、

R³は、ピリミジル(ここで、該ピリミジルは、フッ素、塩素、臭素若しくはシアノ、又は、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシイミノアルキル若しくはアルコキシイミノアルキル(ここで、これらは、それぞれ、1～3個の炭素原子を有する)、又は、ハロアルキル若しくはハロアルコキシ(ここで、これらは、それぞれ、1～3個の炭素原子及び1～7個のハロゲン原子を有する)の、同種の置換基又は異種の置換基で、1～3回置換されることが可能である)を表し;

Xは、フッ素、塩素又は臭素を表す。

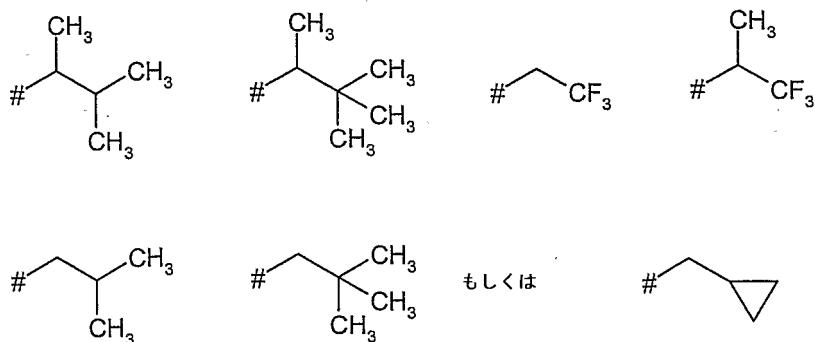
【0015】

式(I)で表される特に好ましいトリアゾロピリミジンにおいては、

R¹は、下記式:

【0016】

【化19】



[式中、#は、結合点を示している]

で表される残基を表すか；

又は、

R^1 は、アリル、ジクロロアリル、プロパルギル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ペリジニル又はモルホリニルを表し；

R^2 は、水素、メチル又はエチルを表すか；

又は、

R^1 と R^2 は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、ピロリジニル、ペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、3,6-ジヒドロ-1(2H)-ペリジニル又はテトラヒドロ-1(2H)-ピリダジニル（ここで、これらの残基は、1~3個のフッ素原子、1~3個のメチル基及び/又はトリフルオロメチルで置換されることが可能である）を表し；

R^3 は、ピリジル（ここで、該ピリジルは、2位又は4位で結合しており、また、該ピリジルは、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、メトキシ、メチルチオ、ヒドロキシイミノメチル、ヒドロキシイミノエチル、メトキシイミノメチル、メトキシイミノエチル及び/又はトリフルオロメチルの、同種の置換基又は異種の置換基で、1~4回置換されることが可能である）を表すか；

又は、

R^3 は、ピリミジル（ここで、該ピリミジルは、4位で結合しており、また、該ピリミジルは、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、メトキシ、メチルチオ、ヒドロキシイミノメチル、ヒドロキシイミノエチル、メトキシイミノメチル、メトキシイミノエチル及び/又はトリフルオロメチルの、同種の置換基又は異種の置換基で、1~3回置換されることが可能である）を表し；

Xは、フッ素又は塩素を表す。

【0017】

上記残基の定義は、互いに任意に組み合わせることができる。さらに、個々の定義を除くこともできる。

【0018】

5,7-ジクロロ-6-(5-クロロピリミジン-4-イル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジンと2,2,2-トリフルオロイソプロピルアミンを初期物質として使用する場合、本発明の方法(a)の過程は、下記図式により表すことができる。

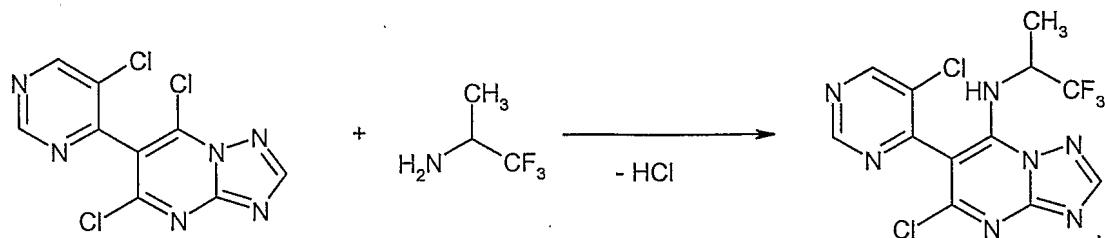
【0019】

20

30

40

【化20】



【0020】

10

本発明の方法(a)を実施する場合に初期物質として必要とされるジハロゲン-トリアゾロ-ピリミジンは、一般に、式(I1)によって定義される。該式(I1)において、R³及びXは、好ましくは、本発明の式(I)で表される物質についての記載に関連してこれらの残基について好ましいとして上記で特定した意味と同じ意味を有する。Y¹は、好ましくは、フッ素、塩素又は臭素を表し、特に好ましくは、フッ素又は塩素を表す。

【0021】

式(I1)で表されるジハロゲン-トリアゾロ-ピリミジンは新規である。これらの物質は、同様に、望ましくない微生物を防除するのに適している。

【0022】

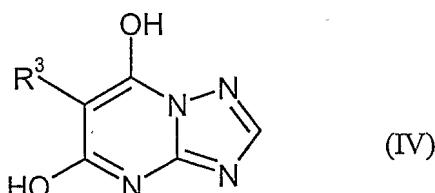
20

これらのジハロゲン-トリアゾロ-ピリミジン類は、

(b) 下記式：

【0023】

【化21】



30

[式中、R³は、上記意味を有する]

で表されるジヒドロキシ-トリアゾロ-ピリミジンを、場合により希釀剤の存在下で、ハロゲン化剤と反応させることにより調製することができる。

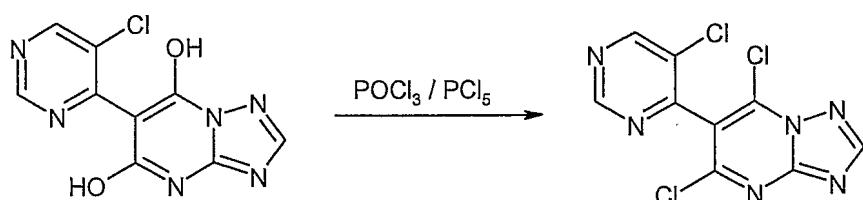
【0024】

6-(5-クロロピリミジン-4-イル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]-ピリミジン-5,7-ジオールを初期物質として使用し、五塩化リンと混合したオキシ塩化リンをハロゲン化剤として使用する場合、本発明の方法(b)の過程は、下記図式により表すことができる。

【0025】

【化22】

40



本発明の方法(b)を実施する場合に初期物質として必要とされるジヒドロキシ-トリアゾロピリミジンは、一般に、式(IV)によって定義される。該式において、R³は、好ましくは、本発明の式(I)で表される物質についての記載に関連してこの残基につい

50

て好ましいとして上記で特定した意味と同じ意味を有する。

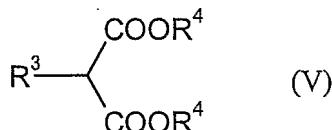
【0026】

式(IV)で表されるジヒドロキシ-トリアゾロ-ピリミジン類は、これまで知られていない。これらは、

(c) 下記式：

【0027】

【化23】

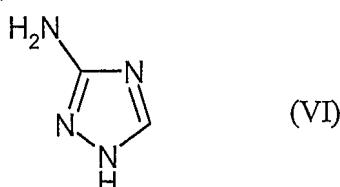


10

[式中、R³は上記意味を有し、R⁴は1~4個の炭素原子を有するアルキルを表す]で表されるヘテロアリールマロン酸エステルを、場合により希釈剤の存在下、及び、場合により酸結合剤の存在下で、下記式：

【0028】

【化24】



20

で表されるアミノトリアゾールと反応させることにより調製することができる。

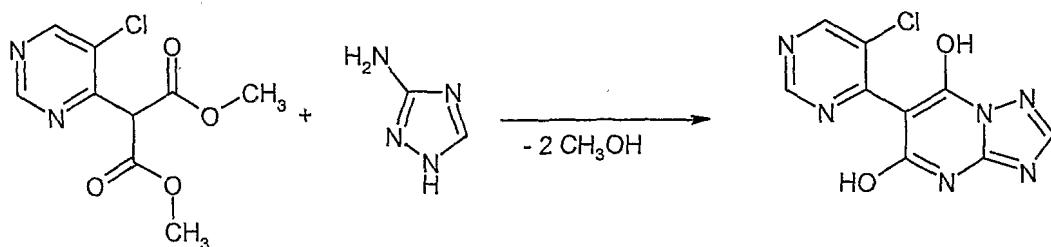
【0029】

2-(5-クロロピリミジン-4-イル)-マロン酸ジメチルエステルと3-アミノトリアゾールを初期物質として使用する場合、本発明の方法(c)の過程は、下記図式により表すことができる。

【0030】

【化25】

30



【0031】

本発明の方法(c)を実施する場合に初期物質として必要とされるヘテロアリールマロン酸エ斯特ルは、一般に、式(V)によって定義される。該式において、R³は、好ましくは、本発明の式(I)で表される物質についての記載に関連してこの残基について好ましいとして上記で特定した意味と同じ意味を有する。R⁴は、メチル又はエチルを表す。

【0032】

式(V)で表されるヘテロアリールマロンエ斯特ルの一部は知られている(c.f.D.E. 3820538-A、及び、WO 01/11965)。

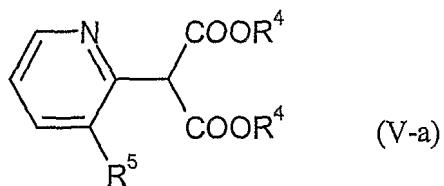
【0033】

下記式：

【0034】

40

【化26】



(V-a)

[式中、

 R^4 は、上記意味を有し； R^5 は、ハロゲン又はハロアルキルを表す]

10

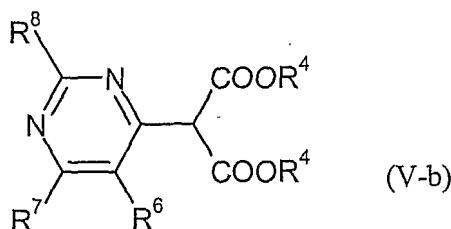
で表されるピリジルマロン酸エステルは、新規である。

【0035】

下記式：

【0036】

【化27】



(V-b)

20

[式中、

 R^4 は、上記意味を有し； R^6 は、ハロゲン又はハロアルキルを表し； R^7 及び R^8 は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル又はメトキシを表す]

で表されるピリミジルマロン酸エステルも新規である。

【0037】

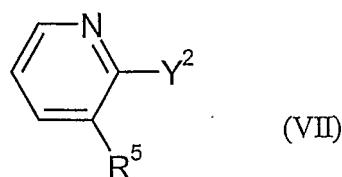
式 (V-a) で表されるピリジルマロン酸エステルは、

30

(d) 下記式：

【0038】

【化28】



(VII)

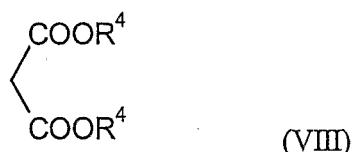
40

[式中、 R^5 は上記意味を有し、 Y^2 はハロゲンを表す]

で表されるハロゲン化ピリジンを、場合により希釀剤の存在下、場合により銅塩の存在下、及び、場合により酸受容体の存在下で、下記式：

【0039】

【化29】



(VIII)

50

[式中、R⁴は上記意味を有する]

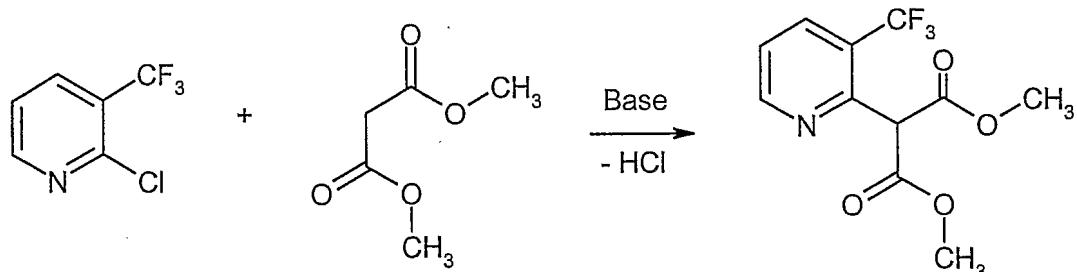
で表されるマロン酸エステルと反応させることにより調製することができる。

【0040】

2-クロロ-3-トリフルオロメチルピリジンとマロン酸ジメチルエステルを初期物質として使用する場合、本発明の方法(d)の過程は、下記図式により表すことができる。

【0041】

【化30】



【0042】

本発明の方法(d)を実施するために初期物質として必要とされるハロゲン化ピリジンは、概して、式(VII)によって定義される。該式において、R⁵は、好ましくは、フッ素、塩素又はトリフルオロメチルを表す。Y²は、好ましくは、塩素又は臭素を表す。

【0043】

式(VII)で表されるハロゲン化ピリジンは、既知の合成化学物質である。

【0044】

本発明の方法(d)を実施するために初期物質としてさらに必要とされる式(VIII)で表されるマロン酸エステルも、既知の合成化学物質である。

【0045】

式(V-b)で表されるピリミジルマロン酸エステルは、

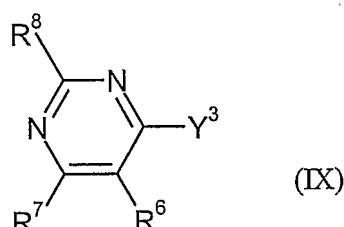
(e)下記式：

【0046】

【化31】

20

30



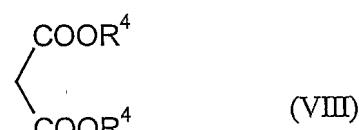
[式中、R⁶、R⁷及びR⁸は上記意味を有し、Y³はハロゲンを表す]

で表されるハロゲン化ピリミジンを、場合により希釈剤の存在下、場合により銅塩の存在下、及び、場合により酸受容体の存在下で、下記式：

【0047】

【化32】

40



[式中、R⁴は上記意味を有する]

で表されるマロン酸エステルと反応させることにより調製することができる。

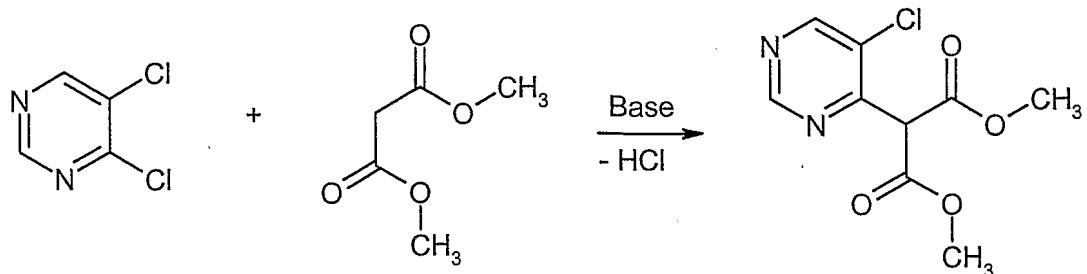
【0048】

50

4, 5 - ジクロロピリミジンとマロン酸ジメチルエステルを初期物質として使用する場合、本発明の方法 (e) の過程は、下記図式により表すことができる。

【0049】

【化33】



【0050】

本発明の方法 (e) を実施するために初期物質として必要とされるハロゲン化ピリミジンは、概して、式 (IX) によって定義される。該式において、R⁶ は、好ましくは、フッ素、塩素又はトリフルオロメチルを表す。R⁷ 及び R⁸ は、好ましくは、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル又はメトキシを表す。Y³ は、好ましくは、塩素又は臭素を表す。

【0051】

式 (IX) で表されるハロゲン化ピリミジンは既知であり、既知方法により調製することができる (cf. J. Chem. Soc. 1955, 3478, 3481)。

【0052】

本発明の方法 (c) を実施するために初期物質としてさらに必要とされる式 (VI) で表されるアミノトリアゾールは、市販されている化学物質である。

【0053】

ヒドロキシ基をハロゲンで置き換えるのに通常使用される成分は、全て、方法 (b) を実施するためのハロゲン化剤であると見なすことができる。三塩化リン、三臭化リン、五塩化リン、オキシ塩化リン、塩化チオニル、臭化チオニル又はこれらの混合物を使用するのが好ましい。式 (II) で表される対応するフッ素化合物は、フッ化カリウムと反応させることにより、塩素化合物又は臭素化合物から調製することができる。

【0054】

そのようなハロゲン化剤は知られている。

【0055】

本発明の方法 (a) を実施するために初期物質としてさらに必要とされるアミンは、一般に、式 (III) によって定義される。該式において、R¹ 及び R² は、好ましくは、本発明の式 (I) で表される化合物についての記載に関連して R¹ 及び R² について好ましいとして上記で与えられている意味と同じ意味を有する。

【0056】

式 (III) で表されるアミンは、既知であるか又は既知方法を用いて調製することができる。

【0057】

通常の不活性有機溶媒は、全て、本発明の方法 (a) を実施するための希釈剤であると見なすことができる。ハロゲン化炭化水素、例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、テトラクロロメタン、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-ブチロニトリル、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

10

20

30

40

50

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；スルホン類、例えば、スルホランなどを使用するのが好ましい。

【0058】

上記のような反応に通常使用される無機塩基又は有機塩基は、全て、本発明の方法(a)を実施するための酸受容体であると見なすことができる。アルカリ土類金属又はアルカリ金属の水素化物、水酸化物、アミド、アルコラート、酢酸塩、炭酸塩又は炭酸水素塩、例えば、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、リチウムジイソプロピルアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、カリウムt-ブチラート、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム及び炭酸水素ナトリウムなどを使用するのが好ましく、さらに、アンモニウム化合物、例えば、水酸化アンモニウム、酢酸アンモニウム及び炭酸アンモニウムなどを使用するのも好ましく、また、第三級アミン、例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジメチルベンジルアミン、ピリジン、N-メチルピリジン、N-メチルモルホリン、N,N-ジメチルアミノピリジン、ジアザビシクロオクタン(DABC0)、ジアザビシクロノネン(DBN)又はジアザビシクロウンデセン(DBU)などを使用するのも好ましい。

10

20

30

40

50

【0059】

上記のような反応に通常使用される反応促進物質は、全て、本発明の方法(a)を実施するための触媒であると見なすことができる。フッ化物、例えば、フッ化ナトリウム、フッ化カリウム又はフッ化アンモニウムなどを使用するのが好ましい。

【0060】

本発明の方法(a)を実施する場合、反応温度はかなり広い範囲で変えることができる。一般に、0 ~ 150 の温度、好ましくは、0 ~ 80 の温度を使用する。

【0061】

本発明の方法(a)を実施する場合、ジハロゲントリアゾロピリミジン1モル当たり、一般に、0.5 ~ 1.0モル、好ましくは、0.8 ~ 2モルの式(III)のアミンを用いる。調製は、通常の方法で実施する。

【0062】

上記のようなハロゲン化に通常使用される溶媒は、全て、本発明の方法(a)を実施するための希釈剤であると見なすことができる。ハロゲン化脂肪族炭化水素又は芳香族炭化水素(例えば、クロロベンゼン)を用いるのが好ましい。しかしながら、ハロゲン化剤自体(例えば、オキシ塩化リン)又はハロゲン化剤の混合物も希釈剤として作用し得る。

【0063】

本発明の方法(b)を実施する場合、反応温度はかなり広い範囲で変えることもできる。一般に、0 ~ 150 の温度、好ましくは、10 ~ 120 の温度を使用する。

【0064】

方法(b)を実施する場合、一般に、式(IV)で表されるジヒドロキシ-トリアゾロピリミジンを過剰量のハロゲン化剤と反応させる。調製は、通常の方法で実施する。

【0065】

上記反応に通常使用される不活性有機溶媒は、全て、本発明の方法(c)を実施するための希釈剤であると見なすことができる。アルコール類、例えば、メタノール、エタノール、n-プロパノール、i-プロパノール、n-ブタノール及びt-ブタノールなどを使用するのが好ましい。

【0066】

上記反応に通常使用される無機塩基及び有機塩基は、全て、方法(c)を実施するための酸結合剤であると見なすことができる。第三級アミン、例えば、トリブチルアミン又はピリジンを使用するのが好ましい。アミンを過剰量で使用する場合、それは、希釈剤とし

ても作用する。

【0067】

方法(c)を実施する場合、反応温度はかなり広い範囲で変えることができる。一般に、20～200の温度、好ましくは、50～180の温度を使用する。

【0068】

方法(c)を実施する場合、式(V)で表されるヘテロアリールマロン酸エステルと式(VI)で表されるアミノトリアゾールは、一般に、等量で反応させる。しかしながら、一方の成分又は他方の成分を過剰に使用することも可能である。調製は、通常の方法で実施する。

【0069】

通常の不活性有機溶媒は、全て、本発明の方法(d)及び方法(e)を実施する場合の希釈剤であると見なすことができる。ハロゲン化炭化水素、例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、テトラクロロメタン、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-ブチロニトリル、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；スルホキシド類、例えば、ジメチルスルホキシド；スルホン類、例えば、スルホラン；アルコール類、例えば、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロパノール、n-ブタノール、i-ブタノール、s-ブタノール、t-ブタノール、エタンジオール、プロパン-1,2-ジオール、エトキシエタノール、メトキシエタノール、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノエチルエーテル；それらと水の混合物を使用するのが好ましく、さらにまた、純水を使用するのも好ましい。

【0070】

通常の銅塩は、本発明の方法(d)及び方法(e)を実施する場合、それぞれの場合における銅塩であると見なすことができる。塩化銅(I)又は臭化銅(I)を使用するのが好ましい。

【0071】

通常の無機塩基又は有機塩基は、本発明の方法(d)及び方法(e)を実施する場合、それぞれの場合における酸受容体であると見なすことができる。アルカリ土類金属又はアルカリ金属の水素化物、水酸化物、アミド、アルコラート、酢酸塩、炭酸塩又は炭酸水素塩、例えば、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、リチウムジイソプロピルアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、カリウムt-ブチラート、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム及び炭酸水素ナトリウムなどを使用するのが好ましく、さらに、アンモニウム化合物、例えば、水酸化アンモニウム、酢酸アンモニウム及び炭酸アンモニウムなどを使用するのも好ましく、また、第三級アミン、例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジメチルベンジルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、N-メチルモルホリン、N,N-ジメチルアミノピリジン、ジアザビシクロオクタン(DABC_O)、ジアザビシクロノネン(DBN)又はジアザビシクロウンデセン(DBU)などを使用するのも好ましい。

【0072】

本発明の方法(d)及び方法(e)を実施する場合、反応温度はかなり広い範囲で変えることができる。一般に、0～150の温度、好ましくは、0～80の温度を使用する。

【0073】

10

20

30

40

50

本発明の方法 (d) を実施する場合、式 (VII) のハロゲン化ピリジン 1 モル当たり、一般に、1 ~ 15 モル、好ましくは、1.3 ~ 8 モルの式 (VIII) のマロン酸エステルを用いる。調製は、通常の方法で実施する。

【0074】

本発明の方法 (e) を実施する場合、式 (IX) のハロゲン化ピリミジン 1 モル当たり、一般に、1 ~ 15 モル、好ましくは、1.3 ~ 8 モルの式 (VIII) のマロン酸エステルを用いる。調製は、通常の方法で実施する。

【0075】

本発明の方法は、一般に、大気圧下で実施する。しかしながら、高圧下で行うことも可能である。

10

【0076】

本発明の物質は、強力な殺菌作用を有している。本発明の物質を使用して、菌類や細菌類のような望ましくない微生物を防除することが可能であり、植物を保護し、また、材料物質 (materials) を保護することができる。

【0077】

殺菌剤 (fungicide) は、植物の保護に使用して、Plasmidiophoromyceses、Oomycetes、Chytridiomycetes、Zygomycetes、Ascomycetes、Basidiomycetes、及び、Deuteromycetes を防除することができる。

【0078】

殺細菌剤 (bactericide) は、植物の保護に使用して、Pseudomonadaceae、Rhizobiaceae、Enterobacteriaceae、Corynebacteriaceae、及び、Streptomycetaceae を防除することができる。

20

【0079】

上記で挙げた属名に属する菌類病及び細菌病の何種類かの病原体を例として挙げることができるが、それらに限定されるものではない：

Xanthomonas 種、例えば、Xanthomonas campestris pv. oryzae ;
 Pseudomonas 種、例えば、Pseudomonas syringae p v. lachrymans ;
 Erwinia 種、例えば、Erwinia amylovora ;
 Pythium 種、例えば、Pythium ultimum ;
 Phytophthora 種、例えば、Phytophthora infestans ;
 Pseudoperonospora 種、例えば、Pseudoperonospora humuli、又は、Pseudoperonospora cubensis ;
 Plasmopara 種、例えば、Plasmopara viticola ;
 Bremia 種、例えば、Bremia lactucae ;
 Peronospora 種、例えば、Peronospora pisii、又は、P. brassicae ;
 Erysiphe 種、例えば、Erysiphe graminis ;
 Sphaerotheca 種、例えば、Sphaerotheca fuliginea ;
 Podosphaera 種、例えば、Podosphaera leucotricha ;
 Venturia 種、例えば、Venturia inaequalis ;
 Pyrenophora 種、例えば、Pyrenophora teres、又は、P. graminea (分生子形態 : Drechslera, 同義語 : Helmintosporium) ;

40

50

Cochliobolus 種、例えば、*Cochliobolus sativus* (分生子形態: *Drechslera*, 同義語: *Helminthosporium*) ; *Uromyces* 種、例えば、*Uromyces appendiculatus* ; *Puccinia* 種、例えば、*Puccinia recondita* ; *Sclerotinia* 種、例えば、*Sclerotinia sclerotiorum* ; *Tilletia* 種、例えば、*Tilletia caries* ; *Ustilago* 種、例えば、*Ustilago nuda*、又は、*Ustilago avenae* ; *Pellicularia* 種、例えば、*Pellicularia sasakii* ; *Pyricularia* 種、例えば、*Pyricularia oryzae* ; *Fusarium* 種、例えば、*Fusarium culmorum* ; *Botrytis* 種、例えば、*Botrytis cinerea* ; *Septoria* 種、例えば、*Septoria nodorum* ; *Leptosphaeria* 種、例えば、*Leptosphaeria nodorum* ; *Cercospora* 種、例えば、*Cercospora canescens* ; *Alternaria* 種、例えば、*Alternaria brassicae* ; 及び、*Pseudocercospora* 種、例えば、*Pseudocercospora ellala* 種、例えば、*Pseudocercospora ellala herpotrichoides*。

【0080】

本発明の活性物質は、植物において、非常に優れた強化作用を有している。従って、本発明の活性物質は、望ましくない微生物による攻撃に対して植物自体の防御を動員させるのに適している。

【0081】

これに関連して、植物を強化する物質（抵抗性を誘導する物質）は、植物の防御システムを刺激して、処理された植物が、その後で望ましくない微生物を接種されたときに、その微生物に対して強い抵抗性を発達させることができるようにする物質であると理解される。

【0082】

この場合は、望ましくない微生物は、植物病原性菌類、植物病原性細菌及び植物病原性ウイルスであると理解される。従って、本発明の物質を用いて、処理後ある一定の期間、上記病原体による攻撃に対して植物を保護することができる。この保護が付与される期間は、該活性物質による植物の処理後、一般に、1～10日間、好ましくは、1～7日間である。

【0083】

植物病害を防除するために必要とされる濃度の該活性物質に対して植物が十分な耐性を有しているということは、植物の地上部、植物及び種子、並びに、土壤に対して処理することが可能であることを意味する。

【0084】

このような状況の下で、本発明の活性物質は、穀類の病害を防除するために（例えば、*Erysiphe* 種に対して）使用して、特に良好な結果を得ることができる。本発明の活性化合物は、また、ブドウの栽培並びに果実及び野菜の栽培における病害を防除するために（例えば、*Botrytis* 種、*Venturia* 種、*Sphaerotheca* 種及び *Podosphaera* 種に対して）使用して、特に良好な結果を得ることができる。

【0085】

本発明の活性物質は、作物の収量を増大させるのにも適している。さらに、本発明の活性物質は、毒性が低く、植物は充分な耐性を示す。

10

20

30

40

50

【0086】

場合により、本発明の活性物質は、ある特定の濃度及び施用量において、除草剤として使用することもできるし、植物の生長に影響を与えるために使用することもできるし、また、害虫 (animal pest) を防除するために使用することもできる。場合により、本発明の活性物質は、さらに、別の活性物質を合成するための中間体及び初期生成物として使用することもできる。

【0087】

本発明により、全ての植物及び植物の一部分を処理することができる。これに関連して、植物というのは、望ましい及び望ましくない野生植物及び栽培植物（自然発生した栽培植物を包含する）のような全ての植物及び植物群であると理解される。栽培植物は、慣習的な栽培及び最適化法によるか、又は、生物工学的方法及び遺伝子工学的方法によるか、又は、それら方法を組み合わせたものにより得ることが可能な植物であり得る。そのような栽培植物には、トランスジェニック植物や、品種所有権により保護することができるか又は保護できない植物品種などが包含される。植物の一部分は、植物の地上及び地下にある部分及び器官、例えば、接ぎ穂、葉、花及び根などを意味するものと理解され、葉、針状葉、茎 (stake) 、幹、花、子実体 (fruiting body) 、果実及び種子、並びに、根、球根及び根茎などを例として挙げることができる。植物の一部分には、さらに、収穫物 (harvested material) 、並びに、栄養繁殖器官及び生殖繁殖器官 (vegetative and generative replicative material) 、例えば、挿し穂、球根、根茎、接ぎ穂及び種子なども包含される。

10

20

30

40

【0088】

本発明の活性物質による植物の処理及び植物の一部分の処理は、慣習的な処理方法を用いて、例えば、浸漬、散布、気化、噴霧、ばらまき (scattering) 又は撒水により、直接的に行うか、又は、植物若しくは植物の一部分の周囲、環境若しくは貯蔵スペースに作用させることにより行い、また、繁殖器官 (replicative material) 、特に種子の場合は、さらに、単層コーティング又は多層コーティングにより行う。

【0089】

材料物質の保護においては、本発明の活性物質を用いて、望ましくない微生物による攻撃又は破壊から工業材料を保護することができる。

【0090】

これに関連して、工業材料とは、工業において使用するために準備された非生体材料であると理解される。例えば、微生物による変化又は破壊から本発明の活性物質で保護することが意図されている工業材料は、接着剤、のり、紙及び厚紙、織物、皮革、木材、塗料及びプラスチック製品、冷却用潤滑油、並びに、微生物により攻撃又は破壊され得る別の材料などであり得る。保護すべき材料物質の範囲のものとしては、製造設備の部品、例えば、微生物の増殖により悪影響を受ける可能性がある冷却水循環路なども挙げができる。本発明の範囲内において、工業材料は、好ましくは、接着剤、のり、紙及び厚紙、皮革、木材、塗料、冷却用潤滑油及び熱媒液 (heat-transfer liquid) であり、特に好ましくは、木材である。

【0091】

工業材料を劣化又は変化させることができる微生物として挙げることができるもののは、例えば、細菌、菌類、酵母、藻類及び粘菌 (slime organism) などである。本発明の活性物質は、好ましくは、菌類、特に、カビ、材木に染みを付け破壊する菌類 (Basidiomycetes) 、並びに、粘菌 (slime organism) 及び藻類に対して作用させる。

【0092】

以下の属の微生物を例として挙げることができる：

Alternaria、例えば、*Alternaria tenuis*；

Aspergillus、例えば、*Aspergillus niger*；

Chaetomium、例えば、*Chaetomium globosum*；

Coniophora、例えば、*Coniophora puetana*；

50

Lentinus、例えば、*Lentinus tigrinus*；
Penicillium、例えば、*Penicillium glaucum*；
Polyporus、例えば、*Polyporus versicolor*；
Aureobasidium、例えば、*Aureobasidium pullulans*；
Sclerotophoma、例えば、*Sclerotophoma pityophila*；
Trichoderma、例えば、*Trichoderma viride*；
Escherichia、例えば、*Escherichia coli*；
Pseudomonas、例えば、*Pseudomonas aeruginosa*；
 及び、
Staphylococcus、例えば、*Staphylococcus aureus*.

10

本発明の活性物質は、それらの個々の物理的及び／又は化学的特性に応じて、慣習的な製剤、例えば、溶液剤、エマルジョン剤、懸濁液剤、粉末剤、泡剤、ペースト剤、粒剤、エーロゾル剤及び高分子物質中の超微細カプセル剤、種子用のコーティング配合物、並びに、ULV冷ミスト製剤及びULV温ミスト製剤などに変換することができる。

【0093】

これらの製剤は、既知方法により、例えば、場合により界面活性剤（即ち、乳化剤及び／又は分散剤及び／又は泡形成剤）を使用して、該活性物質を增量剤（即ち、液体溶媒、加圧下の液化ガス及び／又は固体担体）と混合することにより製造する。增量剤として水を使用する場合、例えば、有機溶媒を補助溶媒として使用することもできる。使用可能な液体溶媒は、実質的に、芳香族化合物、例えば、キシレン、トルエン若しくはアルキルナフタレン、塩素化芳香族化合物又は塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン類、クロロエチレン類若しくは塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサン若しくはパラフィン類、例えば、石油留分、アルコール類、例えば、ブタノール若しくはグリコール、及びそれらのエーテル及びエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン若しくはシクロヘキサン、強極性溶媒、例えば、ジメチルホルムアミド及びジメチルスルホキシド、並びに、水である。液化ガス增量剤又は担体は、通常のな温度及び通常の大気圧下では気体である液体を意味し、例えば、エーロゾル噴射剤、例えば、ハロゲン化炭化水素類や、ブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素などである。使用可能な固体担体は、例えば、粉碎した天然石、例えば、カオリン、クレー、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリナイト又は珪藻土、並びに、粉碎した合成石、例えば、高分散ケイ酸(highly disperse silicic acid)、酸化アルミニウム及びシリケートなどである。粒剤に使用可能な固体担体は、例えば、粉碎し分別した天然石、例えば、方解石、軽石、海泡石及び苦灰岩、並びに、無機粉体又は有機粉体からなる合成顆粒、並びに、有機材料（例えば、おがくず、ココナツの殻、トウモロコシの穂軸及びタバコの茎など）からなる顆粒などである。使用可能な乳化剤及び／又は泡形成剤は、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、アルキルスルフェート類、アリールスルホネート類、及び、タンパク質加水分解産物などである。使用可能な分散剤は、例えば、リグニンスルファイト廃液及びメチセルロースなどである。

20

30

40

【0094】

上記製剤において、接着剤、例えば、カルボキシメチルセルロース、並びに、粉末、顆粒又はラテックスの形態にある天然ポリマー及び合成ポリマー、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、並びに、天然リン脂質、例えば、セファリン及びレシチン、並びに、合成リン脂質などを使用することができる。使用することが可能な別の添加剤は、鉱油及び植物油である。

【0095】

色素、例えば、無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタン及びフェロシアンブルー、並び

50

に、有機染料、例えば、アリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、並びに微量栄養素、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などを使用することができる。

【0096】

上記製剤は、一般に、0.1～95重量%の活性物質、好ましくは、0.5～90重量%の活性物質を含有する。

【0097】

本発明の活性物質は、該活性物質自体として、又はその製剤において、さらにまた、既知の殺菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤若しくは殺虫剤と混合して使用するこが可能であり、それにより、例えば、作用スペクトルを広げたり、又は、抵抗性の発達を回避することができる。多くの場合、このような状況下で相乗効果が得られる。即ち、該混合物の効力は、個々の成分の効力よりも高い。

【0098】

以下の化合物は、例えば、混合相手剤と見なすことができる：

殺菌剤：

2-フェニルフェノール；8-ヒドロキシキノリン硫酸塩；

アシベンゾラル-S-メチル；アルジモルフ；アミドフルメト；アンプロピルホス；アンプロピルホスカリウム；アンドプリム(andoprim)；アニラジン；アザコナゾール；アゾキシストロビン；

ベナラキシル；ベノダニル；ベノミル；ベンチアバリカルブ-イソプロピル；ベンザマクリル；ベンザマクリル-イソブチル；ビラナホス；ビナパクリル；ビフェニル；ビテルタノール；プラスツサイジン-S；ブロムコナゾール；ブピリメート；ブチオベート；ブチルアミン；

カルシウム-ポリスルフィド；カプシマイシン(capsimycin)；カプタホール；キャブタン；カルベンダジム；カルボキシン；カルプロパミド；カルボン；キノメチオネート；クロベンチアゾン；クロルフェナゾール；クロロネブ；クロロタロニル；クロゾリネート；クロジラコン(clozylacon)；シアゾファミド；シフルフェナミド；シモキサニル；シプロコナゾール；シプロジニル；シプロフラム；

Dagger G；デバカルブ(debacarb)；ジクロフルアニド；ジクロン；ジクロロフェン；ジクロシメット；ジクロメジン；ジクロラン；ジエトフェンカルブ；ジフェノコナゾール；ジフルメトリム；ジメチリモール；ジメトモルフ；ジモキシストロビン；ジニコナゾール；ジニコナゾール-M；ジノカップ；ジフェニルアミン；ジピリチオン；ジタリムホス；ジチアノン；ドジン；ドラゾキソロン；

エジフェンホス；エポキシコナゾール；エタボキサム；エチリモール；エトリジアゾール；

ファモキサドン；フェナミドン；フェナパニル；フェナリモール；フェンブコナゾール；フェンフラム；フェンヘキサミド；フェニトロパン；フェノキサニル；フェンピクロニル；フェンプロピジン；フェンプロピモルフ；フェルバム；フルアジナム；フルベンジミン；フルジオキソニル；フルメトベル(flumetover)；フルモルフ(flumorph)；フルオロミド(fluoromide)；フルオキサストロビン(fluoxastrobin)；フルキンコナゾール；フルルプリミドール；フルシラゾール；フルスルファミド；フルトラニル；フルトリアホール；フォルペット；ホセチル-A1；ホセチル-ナトリウム；フベリダゾール；フララキシル；フラメトピル；フルカルバニル；フルメシクロックス；

グアザチン；

ヘキサクロロベンゼン；ヘキサコナゾール；ヒメキサゾール；

イマザリル；イミベンコナゾール；イミノクタジン三酢酸塩；イミノクタジントリス(アルベシル)；ヨードカルブ；イブコナゾール；イプロベンホス；イプロジオン；イプロバリカルブ；イルママイシン；イソプロチオラン；イソバレジオン；

カスガマイシン；クレゾキシム-メチル；

マンゼブ；マネブ；メフェリムゾン；メパニピリム；メプロニル；メタラキシル；メタ

10

20

30

40

50

ラキシル - M ; メトコナゾール ; メタスルホカルブ ; メトフロキサム ; メチラム ; メトミノストロビン ; メトスルフォバックス ; ミルディオマイシン ; ミクロブタニル ; ミクロゾリン ;

ナタマイシン ; ニコビフェン (nicobifen) ; ニトロタル - イソプロピル ; ノビフルムロン ; ヌアリモール ;

オフラセ ; オリサストロビン ; オキサジキシル ; オキソリニック酸 ; オキシポコナゾール ; オキシカルボキシン ; オキシフェンチイン (oxyfenthiin) ;

パクロブトラゾール ; ペフラゾエート ; ペンコナゾール ; ペンシクリン ; ホスダイフェン ; フタリド ; ピコキシストロビン ; ピペラリン (piperalin) ; ポリオキシン ; ポリオキソリム ; プロベナゾール ; プロクロラズ ; プロシミドン ; プロパモカルブ ; プロパンシン - ナトリウム (propanosine-sodium) ; プロピコナゾール ; プロピネブ ; プロキナジド (proquinazid) ; プロチオコナゾール (prothioconazole) ; ピラクロストロビン ; ピラゾホス ; ピリフェノックス ; ピリメタニル ; ピロキロン ; ピロキシフル ; ピロレニトリン (pyrrolnitrine) ;

キンコナゾール ; キノキシフェン ; キントゼン ;

シメコナゾール ; スピロキサミン ; 硫黄 ;

テブコナゾール ; テクロフタラム ; テクナゼン ; テトシクラシス ; テトラコナゾール ; チアベンダゾール ; チシオフェン (thicyofen) ; チフルザミド ; チオファネート - メチル ; チラム ; チオキシミド ; トルクロホス - メチル ; トリルフルアニド ; トリアジメホン ; トリアジメノール ; トリアズブチル ; トリアゾキシド ; トリシクラミド (tricyclamide) ; トリシクラゾール ; トリデモルフ ; トリフロキシストロビン ; トリフルミゾール ; トリホリン ; トリチコナゾール ;

ウニコナゾール ;

バリダマイシン A ; ビンクロゾリン ;

ジネブ ; ジラム ; ゾキサミド ;

(2S) - N - [2 - [4 - [[3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - プロピニル] オキシ] - 3 - メトキシフェニル] エチル] - 3 - メチル - 2 - [(メチルスルホニル) アミノ] ブタンアミド ;

1 - (1 - ナフタレニル) - 1H - ピロール - 2 , 5 - ジオン ;

2 , 3 , 5 , 6 - テトラクロロ - 4 - (メチルスルホニル) ピリジン ;

2 - アミノ - 4 - メチル - N - フェニル - 5 - チアゾールカルボキサミド ;

2 - クロロ - N - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 1H - インデン - 4 - イル) - 3 - ピリジンカルボキサミド ;

3 , 4 , 5 - トリクロロ - 2 , 6 - ピリジンジカルボニトリル ;

アクチノベート (actinovate) ;

シス - 1 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (1H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) シクロヘプタノール ;

1 - (2 , 3 - ジヒドロ - 2 , 2 - ジメチル - 1H - インデン - 1 - イル) - 1H - イミダゾール - 5 - カルボン酸メチル ;

炭酸モノカリウム (monopotassium carbonate) ;

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

ナトリウムテトラチオカルボネート (sodium tetrathiocarbonate) ;

並びに、銅塩及び銅剤、例えば、ボルドー液；水酸化銅；ナフテン酸銅；塩基性塩化銅；硫酸銅；クフラネブ；酸化銅；マンカッパー；有機銅など。

【0099】

殺細菌剤 :

プロノポール ; ジクロロフェン ; ニトラビリン ; ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル ; カスガマイシン ; オクチリノン ; フランカルボン酸 ; オキシテトラサイクリン ; プロベナゾール ; ストレプトマイシン ; テクロフタラム ; 硫酸銅及び別の銅剤。

【0100】

10

20

30

40

50

殺虫剤 / 殺ダニ剤 / 殺線虫剤 :

アバメクチン ; A B G - 9 0 0 8 ; アセフェート ; アセキノシル ; アセタミブリド ; アセトプロール ; アクリナトリン ; A K D - 1 0 2 2 ; A K D - 3 0 5 9 ; A K D - 3 0 8 8 ; アラニカルブ ; アルジカルブ ; アルドキシカルブ ; アレトリン ; アレトリン 1 R - 異性体 ; アルファシペルメトリン (アルファメトリン) ; アミドフルメト ; アミノカルブ ; アミトラズ ; アベルメクチン ; A Z - 6 0 5 4 1 ; アザディラクチン ; アザメチホス ; アジンホス - メチル ; アジンホス - エチル ; アゾシクロチン ;

Bacillus popilliae ; *Bacillus sphaericus* ;
Bacillus subtilis ; *Bacillus thuringiensis* ; *Bacillus thuringiensis* 株EG - 2 3 4 8 ; *Bacillus thuringiensis* 株GC - 9 1 ; *Bacillus thuringiensis* 株N C T C - 1 1 8 2 1 ; バキュロウイルス ; *Beauveria bassiana* ; *Beauveria tenella* ; ベンダイオカルブ ; ベンフラカルブ ; ベンスルタップ ; ベンゾキシメート ; ベータ - シフルトリン ; ベータ - シペルメトリン ; ビフェナゼート ; ビフェントリン ; ビナパクリル ; ビオアレトリン ; ビオアレトリン - S - シクロペンチル - 異性体 ; ビオエタノメトリン (bioethanomethrin) ; ビオペルメトリン ; ビオレスメトリン ; ビストリフルロン ; B P M C ; ブロフェンプロックス (brofenprox) ; ブロモホス - エチル ; ブロモプロビレート ; ブロムフェンビンホス (bromfenvinfos) (-メチル) ; B T G - 5 0 4 ; B T G - 5 0 5 ; ブフェンカルブ ; ブプロフェジン ; ブタチオホス ; ブトカルボキシム ; ブトキシカルボキシム ; ブチルピリダベン (butylpyridaben) ;

カズサホス ; カンフェクロル ; カルバリル ; カルボフラン ; カルボフェノチオン ; カルボスルファン ; カルタップ ; C G A - 5 0 4 3 9 ; キノメチオネート ; クロルダン ; クロルジメホルム ; クロエトカルブ ; クロルエトキシホス ; クロルフェナビル ; クロルフェンビンホス ; クロルフルアズロン ; クロルメホス ; クロロベンジレート ; クロロピクリン ; クロルプロキシフェン (chlorproxyfen) ; クロルピリホス - メチル ; クロルピリホス (-エチル) ; クロバポルトリン (chlovaporthrin) ; クロマフェノジド ; シス - シペルメトリン ; シス - レスマトリン ; シス - ペルメトリン ; クロシトリン (cloocythrin) ; クロエトカルブ ; クロフェンテジン ; クロチアニジン ; クロチアゾベン (clothiazoben) ; コドレモン (codlemone) ; クマホス ; シアノフェンホス ; シアノホス ; シクロprene (cycloprene) ; シクロプロトリン ; Cydia pomonella ; シフルトリン ; シハロトリリン ; シヘキサチン ; シペルメトリン ; シフェノトリン (1 R - トランス - 異性体) ; シロマジン ;

D D T ; デルタメトリン ; ジメトン - S - メチル ; ジメトン - S - メチルスルホン ; ジアフェンチウロン ; ジアリホス ; ダイアジノン ; ジクロフェンチオン ; ジクロルボス ; ジコホル ; ジクロトホス ; ジシクラニル ; ジフルベンズロン ; ジメトエート ; ジメチルビンホス ; ジノブトン ; ジノカップ ; ジノテフラン ; ジオフェノラン ; ジスルホトン ; ドクサト - ナトリウム (docusat-sodium) ; ドフェナピン (dofenapyn) ; D O W C O - 4 3 9 ;

エフルシラネート (eflusilanate) ; エマメクチン ; エマメクチン安息香酸塩 ; エムペントリン (1 R - 異性体) ; エンドスルファン ; E n t o m o p t h o r a spp. ; E P N ; エスフェンバレレート ; エチオフェンカルブ ; エチプロール ; エチオン ; エトプロホス ; エトフェンプロックス ; エトキサゾール ; エトリムホス ;

ファムフル (famphur) ; フェナミホス ; フェナザキン ; 酸化フェンブタスズ ; フェンフルトリン (fenfluthrin) ; フェニトロチオン ; フェノブカルブ ; フェノチオカルブ ; フェノキサクリム ; フェノキシカルブ ; フェンプロパトリル ; フェンピラド ; フェンピリトリン ; フェンピロキシメート ; フェンスルホチオン ; フェンチオン ; フェントリファニル (fentrifanil) ; フェンバレレート ; フィプロニル ; フロニカミド ; フルアクリビリム ; フルアズロン ; フルベンジミン ; フルブロシトリネート (flubrocythrinate) ; フルシクロクスロン ; フルシリトリネート ; フルフェネリム ; フルフェノクスロン ; フルフェ

ンプロックス；フルメトリン；フルピラゾホス；フルテンジン (flutenzin) (フルフェンジン (flufenzine))；フルバリネット；ホノホス；ホルメタネット；ホルモチオン；ホスマチラン；ホスチアゼート；フブフェンプロックス (フルプロキシフェン)；フラチオカルブ；

ガンマ - H C H ; ゴシブルレ (gossyplure) ; グランドルレ (grandlure) ; グラニュローシスウイルス；

ハルフェンプロックス；ハロフェノジド (halofenozide) ; H C H ; H C N - 8 0 1 ; ヘプテノホス；ヘキサフルムロン；ヘキシチアゾクス；ヒドラメチルノン；ハイドロブレン；

I K A - 2 0 0 2 ; イミダクロプリド；イミプロトリン；インドキサカルブ；ヨードフェノホス (iodofenphos) ; イプロベンホス；イサザホス；イソフェンホス；イソプロカルブ；イソキサチオン；イベルメクチン； 10

ジャポニルレ (japonilure) ;

カデトリン；核多角体病ウイルス；キノブレン；

ラムダ - シハロトリン；リンダン；ルフェニュロン；

マラチオン；メカルバム；メスルフェンホス；メタルデヒド；メタム - ナトリウム；メタクリホス；メタミドホス；M e t h a r h i z i u m a n i s o p l i a e ; M e t h a r h i z i u m f l a v o v i r i d e ; メチダチオン；メチオカルブ；メソミル；メトブレン；メトキシクロル；メトキシフェノジド；メトルカルブ；メトキサジアゾン；メビンホス；ミルベメクチン；ミルベマイシン；M K I - 2 4 5 ; M O N - 4 5 7 0 20

0 ; モノクロトホス；モキシデクチン；M T I - 8 0 0 ;

ナレド；N C - 1 0 4 ; N C - 1 7 0 ; N C - 1 8 4 ; N C - 1 9 4 ; N C - 1 9 6 ; ニクロサミド；ニコチン；ニテンピラム；ニチアジン；N N I - 0 0 0 1 ; N N I - 0 1 0 1 ; N N I - 0 2 5 0 ; N N I - 9 7 6 8 ; ノバルロン；ノビフルムロン；

O K - 5 1 0 1 ; O K - 5 2 0 1 ; O K - 9 6 0 1 ; O K - 9 6 0 2 ; O K - 9 7 0 1 ; O K - 9 8 0 2 ; オメトエート；オキサミル；オキシジメトン - メチル；

P a e c i l o m y c e s f u m o s o r o s e u s ; パラチオン - メチル；パラチオン (-エチル)；ペルメトリン (シス - , トランス -)；ペトロレウム (petroleum) ; P H - 6 0 4 5 ; フェノトリ (1 R - トランス異性体)；フェントエート；ホレート；ホサロン；ホスマット；ホスファミドン；ホスホカルブ (phosphocarb) ; ホキシム；ビペロニルブトキシド；ピリミカーブ；ピリミホス - メチル；ピリミホス - エチル；プラレトリん；プロフェノホス；プロメカルブ；プロパホス；プロバルギット；プロペタムホス；プロポクスル；プロチオホス；プロトエート；プロトリフェンブテ (protrifenbuter) ; ピメトロジン；ピラクロホス；ピレスメトリン；ピレスラム；ピリダベン；ピリダリル；ピリダフェンチオン；ピリダチオン (pyridathion) ; ピリミジフェン；ピリプロキシフェン； 30

キナルホス；

レスメトリン；R H - 5 8 4 9 ; リバビリン；R U - 1 2 4 5 7 ; R U - 1 5 5 2 5 ; S - 4 2 1 ; S - 1 8 3 3 ; サリチオン；セブホス (sebufos) ; S I - 0 0 0 9 ; シラフルオフェン；スピノサド；スピロジクロフェン；スピロメシフェン (spiromesifen) ; スルフラミド；スルホテップ；スルプロホス；S Z I - 1 2 1 ; 40

タウ - フルバリネット；テブフェノジド；テブフェンピラド；テブピリムホス (tebupirimfos) ; テフルベンズロン；テフルトリん；テメホス；テミビンホス；ターバム；テルブホス；テトラクロルビンホス；テトラジホン；テトラメトリン；テトラメトリン (1 R - 異性体)；テトラスル；シータ - シペルメトリン；チアクロプリド；チアメトキサム；チアプロニル；チアトリホス (thiatrichos) ; チオシクラムシュウ酸水素塩；チオジカルブ；チオファノックス；チオメトン；チオスルタップ - ナトリウム (thiosultap-sodium) ; チューリングエンシン；トルフェンピラド；トラロシトリ (tralocythrin) ; トラロメトリン；トランスフルトリん；トリアラセン；トリアザメート；トリアゾホス；トリアズロン；トリクロフェニジン (trichlophenidine) ; トリクロルホン；トリフルムロ 50

ン；トリメタカルブ；

バミドチオン；バニリプロール(vaniliprole)；ベルブチン(verbutin)；*Vermicillium lecanii*；

WL-108477；WL-40027；

YI-5201；YI-5301；YI-5302；

XMC；キシリルカルブ；

ZA-3274；ゼータ-シペルメトリン；ゾラプロホス；ZXI-8901；

化合物3-メチル-フェニル-プロピルカルバメート(ツマサイドZ)；

化合物3-(5-クロロ-3-ピリジニル)-8-(2,2,2-トリフルオロエチル)-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-カルボニトリル(CAS-Reg. No. 185982-80-3)及び対応する3-エンド-異性体(CAS-Reg. No. 185984-60-5)(cf. WO-96/37494, WO-98/25923)

並びに、殺虫作用を有する植物抽出物、線虫、菌類又はウイルスを含有する調製物。

【0101】

除草剤のような別の既知活性物質との混合物も可能であり、又は、肥料及び生長調節剤、薬害軽減剤若しくは部分的に共通する化合物(semicochemical)との混合物も可能である。

【0102】

さらにまた、本発明の式(I)で表される化合物は、極めて優れた抗真菌作用も有する。式(I)の化合物は、非常に広い抗真菌活性スペクトルを有しており、特に、皮膚糸状菌、酵母菌、カビ、及び、二相性菌類に対して(例えば、*Candida*種、例えば、*Candida albicans*、*Candida glabrata*に対して)、並びに、*Epidemophyton floccosum*、*Aspergillus*種、例えば、*Aspergillus niger*及び*Aspergillus fumigatus*、*Trichophyton*種、例えば、*Trichophyton mentagrophytes*、*Microsporon*種、例えば、*Microsporon canis*及び*audouini*に対して、非常に広い抗真菌活性スペクトルを有している。これら菌類のリストは、決して適用可能な真菌スペクトルの範囲を限定するものではなく、単に説明のためのものである。

【0103】

さらに、本発明の式(I)で表される化合物は、ヒト及び哺乳動物における腫瘍細胞の成長を抑制するにも適している。これは、チューブリン及びミクロチューブと本発明化合物の相互作用に基づいており、ミクロチューブの重合を促進することにより腫瘍細胞の成長を抑制する。

【0104】

この目的のために、有効量の式(I)で表される1種以上の化合物又はその製薬上許容される塩を投与することができる。

【0105】

本発明の活性物質は、そのままでも使用することができるし、その製剤形態でも使用することができるし、又は、それから調製される施用形態、例えば、即時使用可能な(read-to-use)溶液剤、懸濁液剤、スプレー粉末剤、ペースト剤、可溶性粉末剤、粉剤及び顆粒剤などの形態でも使用することができる。施用は、通常の方法で、例えば、灌水、撒水(splashing)、噴霧、ばらまき(scattering)、散粉、泡状散布(foaming)、塗布などにより行う。さらに、本発明の活性物質は、微量散布法(ultra-low volume method)により施用することも可能であり、又は、該活性物質の調製物若しくは活性物質自体を土壤に注入することも可能である。植物の種子を処理することも可能である。

【0106】

本発明の活性物質を殺菌剤として使用する場合、その使用量は、施用の型に応じて、かなり広い範囲で変えることができる。植物の一部分を処理する場合、該活性物質の使用量

10

20

30

40

50

は、一般に、0.1～10000 g / ha、好ましくは、10～1000 g / haである。種子を処理する場合、使用する活性物質の量は、一般に、種子1 kg当たり0.001～50 g、好ましくは、種子1 kg当たり0.01～10 gである。土壤を処理する場合は、使用する活性物質の量は、一般に、0.1～10000 g / ha、好ましくは、10～5000 g / haである。

【0107】

既に上記で述べたように、本発明により、全ての植物及びその部分を処理することができる。好ましい実施形態では、野生の植物種及び植物品種及びそれらの一部分を処理するか、又は、交雑育種若しくはプロトプラスト融合のような慣習的な生物学的栽培法により得られた植物種及び植物品種及びそれらの一部分を処理する。好ましい別の実施形態では、場合により慣習的な方法と組み合わせた、遺伝子工学的方法により得られたトランスジェニック植物及び植物品種（遺伝子組換え生物（genetically modified organisms））及びそれらの一部分を処理する。用語「部分（parts）」又は「植物の部分（parts of plants）」又は「植物の部分（plant parts）」については、上記で説明した。

【0108】

それぞれ市販されている植物品種又は一般に使用されている植物品種の植物を本発明により処理する場合、特に好ましい。植物品種は、慣習的な栽培方法、突然変異誘発又は組換えDNA技術により栽培された、新しい特性（「形質」）を有する植物であると理解される。それらは、栽培品種、系統、生物型又は遺伝子型であることができる。

【0109】

植物種又は植物品種、それらの生育場所及び生育条件（土壤、気候、生育期、養分）に応じて、本発明による処理の結果として、相加効果を超える効果（相乗効果）が認められる場合がある。従って、例えば、使用量の低減、及び／又は、作用スペクトルの拡大、及び／又は、本発明により使用される物質及び手段の作用の増強、植物の良好な生育、高温及び低温に対する耐性の向上、干ばつ又は水中若しくは土壤中の塩分に対する耐性の向上、開花能力の向上、収穫の容易性の向上、より早い成熟、収穫量の増加、収穫された生産物の品質の向上及び／又は栄養価の増加、収穫された作物の貯蔵性の向上及び／又は加工性の向上などが可能であり、これらは、実際に予期された効果を超えるものである。

【0110】

本発明により処理するのが好ましいトランスジェニック植物又は植物品種（即ち、遺伝子工学的方法により得られた植物又は植物品種）には、特に有利で有益な特性（「形質」）を植物に付与する遺伝物質を遺伝子工学的に修飾することにより得られた全ての植物が含まれる。そのような特性の例は、植物の良好な生育、高温若しくは低温に対する向上した耐性、乾燥又は水中若しくは土壤中に含有される塩分に対する向上した耐性、向上した開花能力、向上した収穫の容易性、向上した成熟速度、増加した収穫量、収穫した生産物の向上した品質及び／又は向上した栄養価、収穫した生産物の向上した貯蔵性及び／又は向上した加工性などである。そのような特性の特に重要なさらなる例は、害虫及び有害な微生物に対する植物の向上した防御力、昆虫、ダニ、植物病原性菌類、細菌及び／又はウイルスに対する植物の向上した防御力、並びに、特定の除草活性物質に対する植物の向上した耐性である。トランスジェニック植物の例としては、重要な栽培植物、例えば、禾穀類（コムギ、イネ）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、ワタ、タバコ、ナタネ、及び、果実植物（果実のリンゴ、ナシ、柑橘類及びグレープを有する植物）などを挙げることができ、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、ワタ、タバコ及びナタネは特に重要である。特に重要な特性（「形質」）には、植物体内で生成された毒素の結果としての、昆虫類、クモ形類動物、線虫類及びカタツムリ類に対する植物の向上した防御力などがあり、特に、バシリス・ツリンギエンシス（*Bacillus thuringiensis*）の遺伝物質（例えば、遺伝子CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIII A、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb及びCryIF並びにこれらの組合せ）により植物（以下、「Bt植物」と称する）体内で生成された毒素の結果としての、昆虫類、クモ形類動物、線虫類及びカタツムリ

10

20

30

40

50

類に対する植物の向上した防御力などがある。特に重要な特性（「形質」）には、全身獲得抵抗性（SAR）、システム（systemin）、フィトアレキシン、誘導因子、並びに、抵抗性遺伝子及び適切に発現されたタンパク質及び毒素による、植物の菌類、細菌及びウイルスに対する向上した防御力などがある。特に重要な特性（「形質」）には、特定の除草活性物質（例えば、イミダゾリノン系、スルホニル尿素系、グリホセート又はホスフィノトリシンなど）に対する植物の向上した耐性などがある（例えば、「PAT」遺伝子）。望ましい該特性（「形質」）を付与する遺伝子は、それぞれの場合に、トランスジェニック植物体内において、相互に組み合わせて存在させることも可能である。「Bt植物」の例としては、トウモロコシ品種、ワタ品種、ダイズ品種及びジャガイモ品種などを挙げることができ、これらは、YIELD GARD（登録商標）（例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ）、Knock Out（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、StarLink（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Bollgard（登録商標）（ワタ）、Nucoton（登録商標）（ワタ）、及び、NewLeaf（登録商標）（ジャガイモ）の商品名で販売されている。除草剤耐性植物の例としては、トウモロコシ品種、ワタ品種及びダイズ品種などを挙げることができ、これらは、Roundup Ready（登録商標）（グリホセートに対する耐性、例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ）、Liberty Link（登録商標）（ホスフィノトリシンに対する耐性、例えば、ナタネ）、IMI（登録商標）（イミダゾリノン系に対する耐性）、及び、STS（登録商標）（スルホニル尿素系に対する耐性、例えば、トウモロコシ）の商品名で販売されている。さらにまた、除草剤抵抗性植物（除草剤耐性に関して慣習的な方法で栽培された植物）の例としては、Clearfield（登録商標）の商品名で販売されている品種（例えば、トウモロコシ）などを挙げができる。ここで述べたことは、もちろん、これらの遺伝特性（「形質」）又は将来において開発される遺伝特性（「形質」）を有し、将来において開発又は販売される植物品種にも適用される。

10

20

30

40

【0111】

ここで挙げた植物は、特に有利に、本発明の一般式（I）の化合物又は本発明の活性物質の混合物で処理することができる。該活性物質又は混合物について上記で述べた好ましい範囲も、これらの植物の処理に適用される。本明細書内で具体的に言及されている化合物又は混合物による植物の処理が、特に重要である。

【実施例】

【0112】

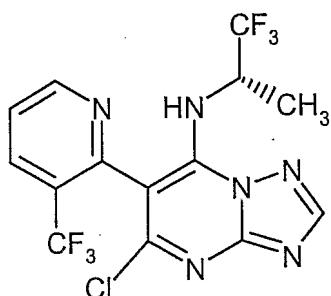
本発明の活性物質の調製及び使用については、下記実施例から推測される。

【0113】

調製実施例実施例1

【0114】

【化34】



【0115】

方法（a）

0.3g（0.9mmol）の5,7-ジクロロ-6-(3-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジンを10mLのアセ

50

トニトリルに溶解させた溶液に、0.1gのフッ化カリウムを添加し、80で2時間攪拌し、次いで、0まで冷却する。この溶液に、0.21g(1.9mmol)の(S)-2,2,2-トリフルオロイソプロピルアミンを添加し、80で18時間攪拌する。この反応混合物を、30mLの1N塩酸に添加し、攪拌し、ジクロロメタンで抽出する。有機相を水で2回洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮する。0.23g(理論収量の60.4%)のN-[5-クロロ-6-[3-(トリフルオロメチル)-2-ピリジニル][1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン-7-イル]-N-[(1S)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル]アミンを得る。

【0116】

HPLC: 10g P = 2.22

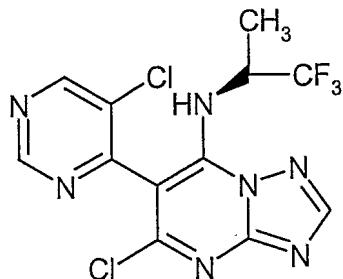
10

【0117】

実施例2

【0118】

【化35】



20

【0119】

方法(a)

0.5g(1.66mmol)の5,7-ジクロロ-6-(5-クロロ-4-ピリミジニル)[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジンを10mLのアセトニトリルに溶解させた溶液に、0.2gのフッ化カリウムを添加し、80で2時間攪拌し、次いで、室温まで冷却する。この溶液に、0.375g(3.32mmol)の(S)-2,2,2-トリフルオロイソプロピルアミンを添加し、80で18時間攪拌する。この反応混合物を、30mLの1N塩酸に添加し、攪拌し、酢酸エチルで抽出する。有機相を水で2回洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮する。残渣を、シリカゲルショートカラムでシクロヘキサン/酢酸エチル(3:1)を用いて濾過する。0.28g(理論収量の44.5%)のN-[5-クロロ-6-(5-クロロ-4-ピリミジニル)[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン-7-イル]-N-[(1S)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル]アミンを得る。

30

HPLC: 10g P = 1.98。

【0120】

上記方法を用いて、下記表1に記載されている式(I)の化合物も得られる。

【0121】

表1

【0122】

40

【表1】

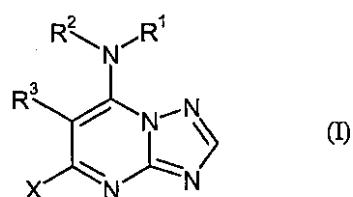


表1

実施例 番号	R ¹	R ²	R ³	X	logP	Fp.(°C):
3	i-Pr ²	-H		-Cl	2,85	133-4
4	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅		-Cl	3,51	Paste
5	-NH-CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -			-Cl	2,52	168-9
6	2,2,2-トリフルオロ-1- エチル	-H		-Cl	2,91	175-6
7	1,2-ジ(フルオロ)ビニル	-H		-Cl	3,13	Paste
8	R-2,2,2-トリフルオロ-1- エチル	-H		-Cl	1,98	

10

20

30

表1(続き)

実施例 番号	R ¹	R ²	R ³	X	logP	Fp.(°C):
9	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	-H		-Cl	3,14	Paste
10	1,2,2-トリフルオロビニル	-H		-Cl	2,8	195-7
11	1,2-ジ(トリフルオロエチル)	-H		-Cl	2,53	153-5
12	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	-H		-Cl	3,28	Paste
13		-H		-Cl	2,16	
14	1,2,2-トリフルオロビニル	-H		-Cl	2,51	
15		-H		-Cl	2,37	

10

20

30

実施例番号	R ¹	R ²	R ³	X	logP	Fp.(°C):
16		-H		-Cl	2,04	
17		-H		-Cl	1,87	
18		-H		-Cl	2,22	
19		-H		-Cl	2,39	

10

20

【0123】

は、結合点を示している。

*) log P 値は、E E C D i r e c t i v e 7 9 / 8 3 1 A n n e x V . A 8 に従い、H P L C (勾配法、アセトニトリル / 0 . 1 % 水性リン酸) により測定した。

【0124】

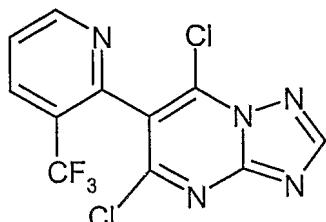
式(II)で表される初期生成物の調製

【0125】

実施例20

【0126】

【化36】



30

40

【0127】

方法(b)

8 g (16 mmol) の 6 - (3 - トリフルオロメチル - ピリジン - 2 - イル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 5 , 7 - ジオールを 12 mL の オキシ塩化リンと混合する。これに、2 . 7 g の五塩化リンを少量ずつ添加する。得られた混合物を 2 時間加熱還流する。冷却した後、その反応混合物を減圧下に濃縮し、100 mL の水と混合し、その都度 100 mL のジクロロメタンで 3 回抽出する。有機相を合して 50 mL の水で 2 回洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮する。残渣を、ジクロロメタン / メチル - t - ブチルエーテル (95 : 5) を用いるシリカゲルクロマトグラフィーに付す。1 . 4 g (理論収量の 25 . 7 %) の 5 , 7 - ジクロロ - 6 - (3 - トリフルオ

50

ロメチル - ピリジン - 2 - イル) - [1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5a]ピリミジンを得る。

【0128】

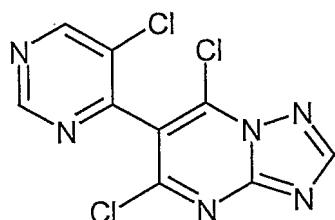
HPLC: log P = 1.97

【0129】

実施例21

【0130】

【化37】



10

【0131】

方法(b)

8 g (16 mmol) の 6 - (5 - クロロ - 4 - ピリミジニル) [1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5 - a]ピリミジン - 5, 7 - ジオールを 25 mL の オキシ 塩化リンと混合する。3.1 g の 五 塩化リンを 少量ずつ 添加する。得られた混合物を 110 °C で 3 時間 搅拌する。室温まで 冷却した 後、その反応混合物を 300 mL の 水と 混合し、その都度 100 mL の ジクロロメタンで 3 回 抽出する。有機相を 合して 硫酸ナトリウムで 脱水し、減圧下に濃縮する。残渣を、ヘキサン / 酢酸エチル (9 : 1 - 5 : 1) を用いるシリカゲルクロマトグラフィーに付す。1.4 g (理論収量の 25.7%) の 5, 7 - ジクロロ - 6 - (5 - クロロ - 4 - ピリミジニル) [1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5 - a]ピリミジンを得る。

20

HPLC: log P = 1.43。

【0132】

式(IV)で表される初期生成物の調製

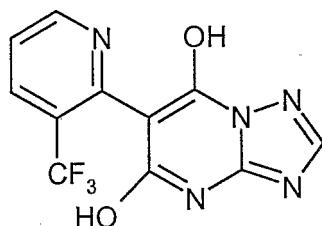
【0133】

実施例22

30

【0134】

【化38】



40

【0135】

方法(c)

5.5 g (19.84 mmol) の 2 - (3 - トリフルオロメチル - ピリジン - 2 - イル) - マロン酸ジメチルエステルと 1.67 g (19.84 mmol) の 3 - アミノ - 1, 2, 4 - トリアゾールを、5.2 mL の トリブチルアミン中、180 °C で 2 時間 搅拌する。この反応中に生成されたメタノールは連続的に留去する。冷却した 後、所望の生成物を トリブチルアミンから 分離させる。その トリブチルアミンを デカントして 除去し、生成物である 6 - (3 - トリフルオロメチル - ピリジン - 2 - イル) - [1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5 - a]ピリミジン - 5, 7 - ジオール (収量: 約 8 g, 純度 60%) は、それ以上 精製することなく 次の 反応ステップで 使用する。

50

【0136】

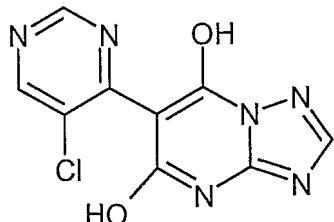
HPLC : log P = -0.23

【0137】

実施例23

【0138】

【化39】



10

【0139】

方法(c)

10 g (40.9 mmol) の 2 - (5 - クロロ - 4 - ピリミジン - 2 - イル) - マロン酸ジメチルエステルと 3.44 g (40.9 mmol) の 3 - アミノ - 1,2,4 - トリアゾールを、10.7 mL のトリプチルアミン中、185 で 2 時間攪拌する。この反応中に生成されたメタノールは連続的に留去する。冷却した後、所望の生成物をトリプチルアミンから分離させる。そのトリプチルアミンをデカントして除去し、生成物である 6 - (5 - クロロ - 4 - ピリミジニル) [1,2,4] トリアゾロ [1,5-a] ピリミジン - 5,7 - ジオール (収量：約 15 g, 純度 11%, 理論収量の約 15%) は、それ以上精製することなく次の反応ステップで使用する。

20

HPLC : log P = -0.23

【0140】

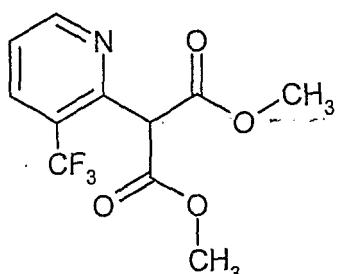
式(V-a)で表される初期生成物の調製

【0141】

実施例24

【0142】

【化40】



30

【0143】

方法(d)

9 g (207 mmol) の 60% 水素化ナトリウム懸濁液を、300 mL のジオキサン中に懸濁させる。これに、55 ~ 60 で、27.29 g (206.6 mmol) のマロン酸ジメチルエステルを滴下して加え、同じ温度でさらに 30 分間攪拌する。8.18 g (82.63 mmol) の塩化銅(I)を添加した後、得られた混合物を 80 に加熱し、次いで、15 g (82.63 mmol) の 2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチルピリジンを滴下して加える。反応混合物を 100 でさらに 14 時間攪拌する。すぐに 15 ~ 20 に冷却した後、その混合物が酸性反応を示すまで、濃塩酸をゆっくりと滴下して加える。600 mL の水と 300 mL のジクロロメタンを添加し、不溶性成分を濾過して除去する。濾液から有機相を分離させ、硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮する。残渣を、ヘキサン / 酢酸エチル (4 : 1) を用いるシリカゲルクロマトグラフィーに付す。10.1 g (理論収量の 40%) の 2 - [3 - トリフルオロメチル] - ピリミジン - 2 - イル)

40

50

- マロン酸ジメチルエステルを得る。

HPLC : 10gP = 2.05。

【0144】

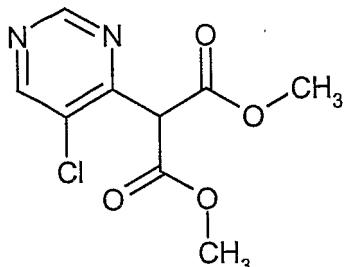
式(V-b)で表される初期生成物の調製

【0145】

実施例25

【0146】

【化41】



10

【0147】

方法(e)

2.6g(65.4mmol)の60%水素化ナトリウム懸濁液を、100mLのテトラヒドロフランに懸濁させる。これに、0で、6.9g(52.4mmol)のマロン酸ジメチルエステルを添加し、同じ温度で0.5時間攪拌する。次いで、6.5g(43.63mmol)の4,5-ジクロロピリミジン溶液を、50mLのテトラヒドロフランに滴下して加え、室温でさらに3時間攪拌する。次いで、150mLの1N塩酸を滴下して加えた後、100mLのジクロロメタンで抽出する。有機相を分離させ、硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮する。残渣を、メチル-t-ブチルエーテル/石油エーテル(1:9)を用いるシリカゲルクロマトグラフィーに付す。7g(理論収量の65.6%)の2-(5-クロロ-4-ピリミジン-2-イル)-マロン酸ジメチルエステルを得る。
HPLC : 10gP = 1.33。

20

【0148】

4,5-ジクロロピリミジンの調製

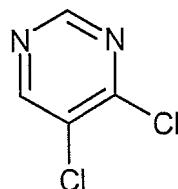
30

【0149】

実施例26

【0150】

【化42】



40

【0151】

112.5g(673.7mmol)の5-クロロ-6-オキソ-1,6-ジヒドロピリミジン-1-イウムクロリドを630mLのオキシ塩化リンに溶解させた溶液に、1.6mLのジメチルアミンを添加し、3時間加熱還流する。次いで、余分なオキシ塩化リンを減圧下に留去する。冷却した後、残渣を、1.5Lの氷水に注ぎ、500mLのジクロロメタンで抽出する。有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮する。72.3g(理論収量の66.3%)の4,5-ジクロロピリミジンを得る。

HPLC : 10gP = 1.35。

【0152】

5-クロロ-6-オキソ-1,6-ジヒドロピリミジン-1-イウムクロリドの調製

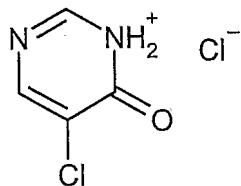
50

【0153】

実施例27

【0154】

【化43】



10

【0155】

77 g (0.8 mol) の 4 (3H) - ピリミジノンを 770 mL の氷酢酸に溶解させた溶液に、6.5 g (40 mmol) の塩化鉄 (III) を添加し、40 ~ 45 度、113.6 g (1.6 mol) の塩素を加える。その反応混合物を 15 分に冷却し、得られた固体生成物をエーテルで抽出及び洗浄する。112.5 g (理論収量の 84%) の 5 - クロロ - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリミジン - 1 - イウムクロリドを得る。

【0156】

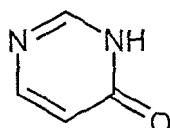
4 (3H) - ピリミジノンの調製

【0157】

実施例28

【0158】

【化44】



20

【0159】

1.2 L のエタノール中の 103 g (0.804 mol) の 6 - メルカプト - 4 (1H) - ピリミジノン (JP 50053381, Chem. Abstr. CAN 84 : 17404) と 141.5 g (1.2 mol) の ラネニッケルの混合物を、8 時間加熱還流する。その溶液を熱濾過し、残渣をエタノールで洗浄し、濾液を減圧下に濃縮する。67.2 g (理論収量の 87%) の 4 (3H) - ピリミジノンを得る。

30

【0160】

使用実施例実施例A

【0161】

【表2】

Podosphaera試験(リンゴ) / 保護

40

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 重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

【0162】

1 重量部の活性物質を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で所望の濃度に希釈して、活性物質の適切な調製物を調製する。

【0163】

保護活性について試験するために、幼植物に、特定量の活性物質の調製物を散布する。散布によるコーティングが乾燥した後、リンゴのうどんこ病の病原体である Podosphaera leucotricha の胞子の水性懸濁液を用いて該植物に接種する。次

50

いで、接種した植物を、約 23 で相対湿度約 70 % の温室内に置く。

【0164】

評価は、上記接種の 10 日後に行う。この評価において、0 % は、対照に相当する効力を意味し、100 % の効力は、攻撃が観察されなかったことを意味する。

【0165】

この試験において、実施例 1、実施例 2、実施例 8、実施例 10、実施例 11、実施例 13、実施例 14、実施例 15、実施例 16 及び実施例 17 で得た本発明の物質は、100 g / ha の量で用いた場合、90 % を超える効力を示す。

【0166】

実施例 B

【0167】

【表 3】

Venturia試験(リンゴ)／保護

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 重量部のアルキルーアリールーポリグリコールエーテル

10

【0168】

1 重量部の活性物質を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で所望の濃度に希釈して、活性物質の適切な調製物を調製する。

20

【0169】

保護活性について試験するために、幼植物に、特定量の活性物質の調製物を散布する。散布によるコーティングが乾燥した後、リンゴの黒星病の病原体である Venturia inaequalis の分生子の水性懸濁液を用いて該植物に接種し、次いで、植物を、約 20 で相対湿度 100 % のインキュベーション室内に 1 日間置いておく。

【0170】

次いで、植物を、約 21 で相対湿度約 90 % の温室内に置く。

【0171】

評価は、上記接種の 10 日後に行う。この評価において、0 % は、対照に相当する効力を意味し、100 % の効力は、攻撃が観察されなかったことを意味する

30

この試験において、実施例 2、実施例 13、実施例 14、実施例 15、実施例 16 及び実施例 17 で得た本発明の物質は、100 g / ha の量で用いた場合、90 % を超える効力を示す。

【0172】

実施例 C

【0173】

【表 4】

Botrytis試験(マメ)／保護

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 重量部のアルキルーアリールーポリグリコールエーテル

40

【0174】

1 重量部の活性物質を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で所望の濃度に希釈して、活性物質の適切な調製物を調製する。

【0175】

保護活性について試験するために、幼植物に、特定量の活性物質の調製物を散布する。散布によるコーティングが乾燥した後、Botrytis cinerea が増殖している寒天の小片 2 個を各葉の上に置く。次いで、接種した植物を、約 20 で相対湿度 100 % の暗室内に置く。

50

【0176】

上記接種の2日後、葉面の発病しているスポットの寸法について評価する。この評価において、0%は、対照に相当する効力を意味し、100%の効力は、攻撃が観察されなかつことを意味する。

【0177】

この試験において、実施例2、実施例13、実施例15及び実施例16で得た本発明の物質は、500g/h aの量で用いた場合、90%を超える効力を示す。

【0178】

実施例D

【0179】

【表5】

Sphaerotheca試験(キュウリ)／保護

溶媒： 49重量部のN, N-ジメチルホルムアミド

乳化剤： 1重量部のアルキルーアリールーポリグリコールエーテル

10

【0180】

1重量部の活性物質を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で所望の濃度に希釈して、活性物質の適切な調製物を調製する。

【0181】

保護活性について試験するために、キュウリ幼植物に、特定量の活性物質の調製物を散布する。処理を行った1日後、Sphaerotheca fuligineaの胞子懸濁液を用いて該植物に接種する。次いで、植物を、23の温度で相対湿度70%の温室に置く。

20

【0182】

評価は、上記接種の7日後に行う。この評価において、0%は、対照に相当する効力を意味し、100%の効力は、攻撃が観察されなかつことを意味する

この試験において、実施例2及び実施例8で得た本発明の物質は、750g/h aの量で用いた場合、90%を超える効力を示す。

【0183】

30

実施例E

【0184】

【表6】

Erysiphe試験(コムギ)／保護

溶媒： 25重量部のN, N-ジメチルホルムアミド

乳化剤： 0.6重量部のアルキルーアリールーポリグリコールエーテル

【0185】

1重量部の活性物質を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で所望の濃度に希釈して、活性物質の適切な調製物を調製する。

40

【0186】

保護活性について試験するために、幼植物に、特定量の活性物質の調製物を散布する。散布によるコーティングが乾燥した後、Erysiphe graminis f. sp. triticiの胞子を該植物に振りかける。

【0187】

次いで、植物を、約20の温度で相対湿度約80%の温室内に置いて、うどんこ病の小突起(pustule)の発達を促進する。

【0188】

評価は、上記接種の7日後に行う。この評価において、0%は、対照に相当する効力を

50

意味し、100%の効力は、攻撃が観察されなかったことを意味する。

【0189】

この試験において、実施例2で得た本発明の物質は、500g/haの量で用いた場合、90%を超える効力を示す。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.
EP2004/005876

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07D487/04 C07D213/61 C07D213/55 A01N43/90
//(C07D487/04, 249:00, 239:00)

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data, BIOSIS, EMBASE

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, X	WO 2004/011467 A (HOKKO CHEM IND CO ; MURAKAMI HIDEYUKI (JP); WAKABAYASHI HITOSHI (JP);) 5 February 2004 (2004-02-05) *Schema 1 und 2*claims; tables 4-17, 26	1-16
X	WO 02/50077 A (HENRICH MARIELOUISE ; MAULER-MACHNIK ASTRID (DE); HILGERS PETRA (DE);) 27 June 2002 (2002-06-27) page 12, line 4 - line 18; claim 3	4-9
X	WO 94/20501 A (SHELL INT RESEARCH ; PEES KLAUS JUERGEN (DE); BECHER HEINZ MANFRED (DE) 15 September 1994 (1994-09-15) page 2, line 20; claim 2 page 7, line 25 - page 8, line 11 page 9, line 16 - line 19	1-16
		-/-

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

& document member of the same patent family

Date of the actual completion of the International search

Date of mailing of the International search report

21 September 2004

04/10/2004

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Härtinger, S

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP2004/005876

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 02/02563 A (AMERICAN HOME PROD) 10 January 2002 (2002-01-10) page 73, line 9 - line 11; claim 2 -----	1-3,5-8
A	WO 03/008417 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 30 January 2003 (2003-01-30) cited in the application page 2, line 35 - page 4, line 16 -----	1-16
A	YASUO MAKISUMI: "SYNTHESIS OF POTENTIAL ANTICANCER AGENTS VI. REACTIVITY OF 6-BROMO-S-TRIAZOLO 2,3-APYRIMIDINES" CHEMICAL AND PHARMACEUTICAL BULLETIN, TOKYO, JP, vol. 9, 1961, pages 814-817, XP001040489 ISSN: 0009-2363 *Formel VII und VIII* -----	11,12
A	DATABASE WPI Section Ch, Week 197438 Derwent Publications Ltd., London, GB; Class B03, AN 1974-67401V XP002297148 -& SU 407 902 A (ORG CHEM INST UKR SSR) 25 April 1974 (1974-04-25) abstract -----	13-16
A	US 6 156 925 A (EISENACHT RUDI ET AL) 5 December 2000 (2000-12-05) column 2, line 36 - line 40; claims 1,4 -----	13-16
A	LIPPmann E ET AL: "UEBER 1,2,4-TRIAZOLOÄ1,5-AÜ PYRIMIDINE SYNTHESIS WITH 5-HYDRAZINO-1,2,4-TRIAZOLOÄ1,5-AÜPYRIMIDIN E" PHARMAZIE, VEB VERLAG VOLK UND GESUNDHEIT. BERLIN, DD, vol. 46, no. 3, 1991, pages 184-187, XP001182663 ISSN: 0031-7144 table 1 -----	4,9

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

EP04/5876

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. Claims Nos.: because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
Although, according to page 25 of the description, claims 6 and 7 also relate to a method for treating the human or animal body, a search was carried out and was based on the stated effects of the compound.
2. Claims Nos.: because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. Claims Nos.: because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
 No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP2004/005876

Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)		Publication date
WO 2004011467	A	05-02-2004	WO	2004011467 A1		05-02-2004
WO 0250077	A	27-06-2002	DE	10063115 A1	27-06-2002	
			AU	3167602 A	01-07-2002	
			WO	0250077 A2	27-06-2002	
			EP	1349859 A2	08-10-2003	
			JP	2004516296 T	03-06-2004	
			US	2004097522 A1	20-05-2004	
WO 9420501	A	15-09-1994	AT	159722 T	15-11-1997	
			AU	690899 B2	07-05-1998	
			AU	6258094 A	26-09-1994	
			BR	9405988 A	26-12-1995	
			CA	2157293 A1	15-09-1994	
			CN	1119015 A ,B	20-03-1996	
			CZ	9502233 A3	17-01-1996	
			DE	69406538 D1	04-12-1997	
			DK	699200 T3	20-07-1998	
			WO	9420501 A1	15-09-1994	
			EP	0699200 A1	06-03-1996	
			HK	1004332 A1	20-11-1998	
			HU	73163 A2	28-06-1996	
			IL	108747 A	12-03-1999	
			JP	3438892 B2	18-08-2003	
			JP	8507505 T	13-08-1996	
			NZ	262729 A	26-01-1996	
			PL	310467 A1	11-12-1995	
			RU	2130459 C1	20-05-1999	
			SG	48860 A1	18-05-1998	
			SK	106895 A3	05-06-1996	
			US	5854252 A	29-12-1998	
			ZA	9401485 A	10-11-1994	
WO 0202563	A	10-01-2002	AU	7306201 A	14-01-2002	
			BG	107277 A	30-01-2004	
			BR	0112038 A	01-04-2003	
			CA	2413802 A1	10-01-2002	
			CZ	20024150 A3	17-09-2003	
			EP	1307200 A2	07-05-2003	
			HU	0300798 A2	28-07-2003	
			JP	2004502691 T	29-01-2004	
			NO	20026195 A	27-02-2003	
			SK	18412002 A3	03-06-2003	
			WO	0202563 A2	10-01-2002	
			US	2002068744 A1	06-06-2002	
WO 03008417	A	30-01-2003	BR	0211180 A	10-08-2004	
			CA	2453639 A1	30-01-2003	
			WO	03008417 A1	30-01-2003	
			EP	1412359 A1	28-04-2004	
			US	2004162286 A1	19-08-2004	
SU 407902	A	10-12-1973	SU	407902 A1	10-12-1973	
US 6156925	A	05-12-2000		NONE		

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

P/EP2004/005876

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
 IPK 7 C07D487/04 C07D213/61 C07D213/55 A01N43/90
 //((C07D487/04, 249:00, 239:00))

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprästoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
 IPK 7 C07D A01N

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

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

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data, BIOSIS, EMBASE

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P, X	WO 2004/011467 A (HOKKO CHEM IND CO ; MURAKAMI HIDEYUKI (JP); WAKABAYASHI HITOSHI (JP);) 5. Februar 2004 (2004-02-05) *Schema 1 und 2*Ansprüche; Tabellen 4-17,26	1-16
X	WO 02/50077 A (HENRICH MARIELOUISE ; MAULER-MACHNIK ASTRID (DE); HILGERS PETRA (DE);) 27. Juni 2002 (2002-06-27) Seite 12, Zeile 4 - Zeile 18; Anspruch 3	4-9
X	WO 94/20501 A (SHELL INT RESEARCH ; PEES KLAUS JUERGEN (DE); BECHER HEINZ MANFRED (DE) 15. September 1994 (1994-09-15) Seite 2, Zeile 20; Anspruch 2 Seite 7, Zeile 25 - Seite 8, Zeile 11 Seite 9, Zeile 16 - Zeile 19	1-16
		-/-

 Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen Siehe Anhang Patentfamilie

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

Datum des Abschlusses der Internationalen Recherche	Absendeadatum des Internationalen Recherchenberichts
21. September 2004	04/10/2004
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL ~ 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Bevollmächtigter Bediensteter Härtinger, S

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

/EP2004/005876

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 02/02563 A (AMERICAN HOME PROD) 10. Januar 2002 (2002-01-10) Seite 73, Zeile 9 ~ Zeile 11; Anspruch 2 _____	1-3,5-8
A	WO 03/008417 A (GRAMMENOS WASSILIOS ; RHEINHEIMER JOACHIM (DE); BASF AG (DE); GEWEHR M) 30. Januar 2003 (2003-01-30) in der Anmeldung erwähnt Seite 2, Zeile 35 ~ Seite 4, Zeile 16 _____	1-16
A	YASUO MAKISUMI: "SYNTHESIS OF POTENTIAL ANTICANCER AGENTS VI. REACTIVITY OF 6-BROMO-S-TRIAZOLO 2,3-APYRIMIDINES" CHEMICAL AND PHARMACEUTICAL BULLETIN, TOKYO, JP, Bd. 9, 1961, Seiten 814-817, XP001040489 ISSN: 0009-2363 *Formel VII und VIII* _____	11,12
A	DATABASE WPI Section Ch, Week 197438 Derwent Publications Ltd., London, GB; Class B03, AN 1974-67401V XP002297148 -& SU 407 902 A (ORG CHEM INST UKR SSR) 25. April 1974 (1974-04-25) Zusammenfassung _____	13-16
A	US 6 156 925 A (EISENACHT RUDI ET AL) 5. Dezember 2000 (2000-12-05) Spalte 2, Zeile 36 ~ Zeile 40; Ansprüche 1,4 _____	13-16
A	LIPPMANN E ET AL: "UEBER 1,2,4-TRIAZOLOÄ1,5-AÜ PYRIMIDINE SYNTHESIS WITH 5-HYDRAZINO-1,2,4-TRIAZOLOÄ1,5-AÜPYRIMIDIN E" PHARMAZIE, VEB VERLAG VOLK UND GESUNDHEIT. BERLIN, DD, Bd. 46, Nr. 3, 1991, Seiten 184-187, XP001182663 ISSN: 0031-7144 Tabelle 1 _____	4,9

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

PCT/EP2004/005876

Feld II Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1. Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
Obwohl die Ansprüche 6 und 7 sich laut Seite 25 der Beschreibung auch auf ein Verfahren zur Behandlung des menschlichen oder tierischen Körpers beziehen, wurde die Recherche durchgeführt und gründete sich auf die angeführten Wirkungen der Verbindung.
2. Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Teile der Internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
3. Ansprüche Nr.
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgeäßt sind.

Feld III Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die Internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

1. Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser Internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
2. Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchengebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
3. Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser Internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
4. Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der Internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt;

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

- Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.
 Die Zahlung zusätzlicher Recherchengebühren erfolgte ohne Widerspruch.

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/005876

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
WO 2004011467	A	05-02-2004	WO	2004011467 A1		05-02-2004
WO 0250077	A	27-06-2002	DE	10063115 A1	27-06-2002	
			AU	3167602 A	01-07-2002	
			WO	0250077 A2	27-06-2002	
			EP	1349859 A2	08-10-2003	
			JP	2004516296 T	03-06-2004	
			US	2004097522 A1	20-05-2004	
WO 9420501	A	15-09-1994	AT	159722 T	15-11-1997	
			AU	690899 B2	07-05-1998	
			AU	6258094 A	26-09-1994	
			BR	9405988 A	26-12-1995	
			CA	2157293 A1	15-09-1994	
			CN	1119015 A ,B	20-03-1996	
			CZ	9502233 A3	17-01-1996	
			DE	69406538 D1	04-12-1997	
			DK	699200 T3	20-07-1998	
			WO	9420501 A1	15-09-1994	
			EP	0699200 A1	06-03-1996	
			HK	1004332 A1	20-11-1998	
			HU	73163 A2	28-06-1996	
			IL	108747 A	12-03-1999	
			JP	3438892 B2	18-08-2003	
			JP	8507505 T	13-08-1996	
			NZ	262729 A	26-01-1996	
			PL	310467 A1	11-12-1995	
			RU	2130459 C1	20-05-1999	
			SG	48860 A1	18-05-1998	
			SK	106895 A3	05-06-1996	
			US	5854252 A	29-12-1998	
			ZA	9401485 A	10-11-1994	
WO 0202563	A	10-01-2002	AU	7306201 A	14-01-2002	
			BG	107277 A	30-01-2004	
			BR	0112038 A	01-04-2003	
			CA	2413802 A1	10-01-2002	
			CZ	20024150 A3	17-09-2003	
			EP	1307200 A2	07-05-2003	
			HU	0300798 A2	28-07-2003	
			JP	2004502691 T	29-01-2004	
			NO	20026195 A	27-02-2003	
			SK	18412002 A3	03-06-2003	
			WO	0202563 A2	10-01-2002	
			US	2002068744 A1	06-06-2002	
WO 03008417	A	30-01-2003	BR	0211180 A	10-08-2004	
			CA	2453639 A1	30-01-2003	
			WO	03008417 A1	30-01-2003	
			EP	1412359 A1	28-04-2004	
			US	2004162286 A1	19-08-2004	
SU 407902	A	10-12-1973	SU	407902 A1	10-12-1973	
US 6156925	A	05-12-2000	KEINE			

フロントページの続き

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

- (72)発明者 ゲバウアー , オーラフ
 ドイツ国、50737・ケルン、イエズイテンガツセ・111
- (72)発明者 ハイネマン , ウルリヒ
 ドイツ国、42799・ライヒリンゲン、アム・ゾンネンバンク・1
- (72)発明者 エルベ , ハンス - ルートビヒ
 ドイツ国、42329・ブツパートール、ダスネットケル・59
- (72)発明者 ガイヤー , ヘルベルト
 ドイツ国、40789・モンハイム、ザントシュトラーセ・66
- (72)発明者 ヘルマン , シュテファン
 ドイツ国、40764・ランゲンフェルト、ファイルネブルガーシュトラーセ・4・アー
- (72)発明者 グロイル , イエルク・ニコ
 ドイツ国、42799・ライヒリンゲン、アム・ザントベルク・30・アー
- (72)発明者 クリューガー , ベルント - ブイーラント
 ドイツ国、51467・ベルギシュ・グラートバッハ、アム・フォレント・52
- (72)発明者 ヒルプラント , シュテファン
 ドイツ国、41462・ノイス、ロートリンガー・シュトラーセ・22
- (72)発明者 エツベルト , ロナルド
 ドイツ国、90475・ニュルンベルク、レスコウシュトラーセ・60
- (72)発明者 バッヘンドルフ - ノイマン , ウルリケ
 ドイツ国、56566・ノイビート、オーバラー・マルケンベーク・85
- (72)発明者 ダーメン , ペーター
 ドイツ国、41470・ノイス、アルテブリュツカーシュトラーセ・61
- (72)発明者 クツク , カール - ハインツ
 ドイツ国、40764・ランゲンフェルト、パストア - レー - シュトラーセ・30・アー
- F ターム(参考) 4C050 AA01 BB06 CC08 EE04 FF01 GG02 GG04 HH04
 4H011 AA01 BA05 BB09 BC05 BC06 BC19 DA16 DH03