

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2005-523934

(P2005-523934A)

(43) 公表日 平成17年8月11日(2005.8.11)

(51) Int.Cl.⁷

C07D 317/62

A01N 43/30

A01N 43/32

A01N 43/56

A01N 43/78

F I

C07D 317/62

A01N 43/30

A01N 43/32

A01N 43/56

A01N 43/78

C S P

B

B

テーマコード (参考)

4C063

4H011

4H039

審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全 95 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2004-501363 (P2004-501363)
 (86) (22) 出願日 平成15年4月16日 (2003. 4. 16)
 (85) 翻訳文提出日 平成16年12月13日 (2004. 12. 13)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2003/003964
 (87) 国際公開番号 W02003/093223
 (87) 国際公開日 平成15年11月13日 (2003. 11. 13)
 (31) 優先権主張番号 102 19 035.6
 (32) 優先日 平成14年4月29日 (2002. 4. 29)
 (33) 優先権主張国 ドイツ (DE)

(71) 出願人 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 100062007
 弁理士 川口 義雄
 (74) 代理人 100113332
 弁理士 一入 章夫
 (74) 代理人 100114188
 弁理士 小野 誠
 (74) 代理人 100103920
 弁理士 大崎 勝真
 (74) 代理人 100124855
 弁理士 坪倉 道明

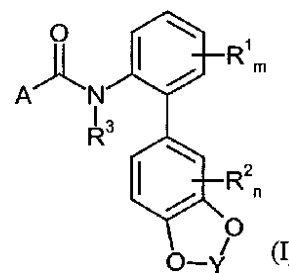
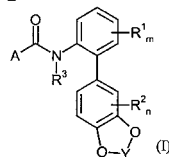
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 ビオフェニルカルボキサミド

(57) 【要約】

式中の R^1 、 R^2 、 m 、 n 、 R^3 、 Y 、および A は、その記述に示されている意味を有する式 (I) の新規なビフェニルカルボキサミド、前記物質を製造するためのいくつかの方法、望まれていない微生物を抑制するためのその物質の使用、および新しい中間生成物およびその製造が開示されている。

【化194】

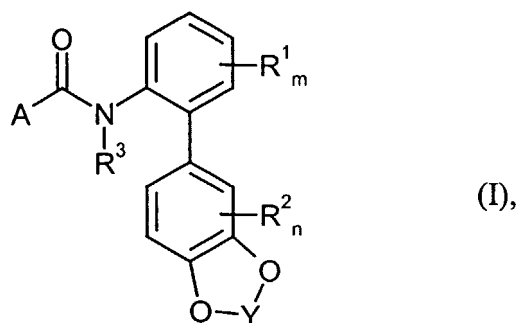


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) のビフェニルカルボキサミド

【化 1】



10

[式中、

R^1 および R^2 は、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_8$ -アルキル、 $C_1 \sim C_8$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ、または $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルチオを表し、いずれの場合にも 1 ~ 13 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有し、

m は、1、2、3、または 4 を表し、ここで m が 2、3、または 4 を表す場合、 R^1 は同じ基または異なる基を表し、

20

n は、1、2、または 3 を表し、ここで n が 2 または 3 を表す場合、 R^2 は同じ基または異なる基を表し、

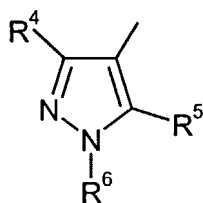
R^3 は、水素、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、シアノ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、1 ~ 7 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルフェニル、1 ~ 7 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルフェニル、($C_1 \sim C_6$ -アルキル)カルボニル、カルバモイルを表し、

Y は、カルボニルを表し、または、場合によっては、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ、および / または $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルチオ (いずれの場合にも 1 ~ 13 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する) から成る群からの同じ置換基または異なる置換基によって一置換または多置換されている $C_1 \sim C_3$ -アルキレンを表し、

30

A は次式の基を表し

【化 2】



40

上式で、

R^4 は、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルチオ、アミノカルボニル、またはアミノカルボニル- $C_1 \sim C_4$ -アルキルを表し、

50

R^5 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、または $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオを表し、

R^6 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、ヒドロキシ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルチオ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、またはフェニルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し

【化3】

10



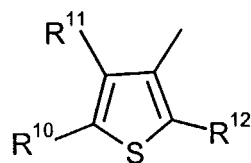
上式で、

R^7 および R^8 は、互いに独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、または1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルを表し、

R^9 は、水素、シアノ、または $C_1 \sim C_4$ -アルキル、または1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し

【化4】



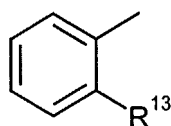
上式で、

R^{10} および R^{11} は、互いに独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、または1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルを表し、

R^{12} は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、またはハロゲンを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し

【化5】



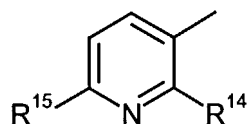
上式で、

R^{13} は、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、または1～5個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルチオを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し

40

【化 6】



上式で、

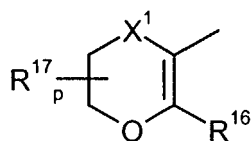
R^{14} は、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルチオ、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルコキシを表し、

10

R^{15} は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルスルフィニル、または $C_1 \sim C_4$ - アルキルスルホニルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し

【化 7】



20

上式で、

R^{16} は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、

R^{17} は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルを表し、

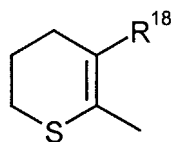
X^1 は、硫黄原子を表し、 SO 、 SO_2 、または CH_2 を表し、

p は、0、1、または 2 を表し、ここで p が 2 を表す場合、 R^{17} は同じ基または異なる基を表し、

あるいは、A は次式の基を表し

30

【化 8】



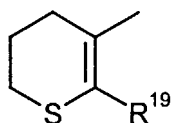
上式で、

R^{18} は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し

40

【化 9】

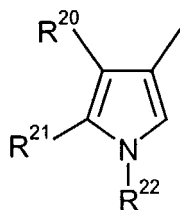


上式で、

R^{19} は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、

50

あるいは、Aは次式の基を表し
【化10】



上式で、

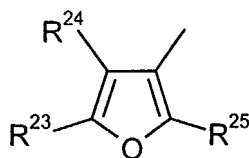
R²⁰は、ハロゲン、シアノ、C₁～C₄-アルキル、または1～5個のハロゲン原子を有するC₁～C₄-ハロアルキルを表し、

R²¹は、水素、ハロゲン、C₁～C₄-アルキル、または1～5個のハロゲン原子を有するC₁～C₄-ハロアルキルを表し、

R²²は、水素、シアノ、C₁～C₄-アルキル、または1～5個のハロゲン原子を有するC₁～C₄-ハロアルキル、C₁～C₄-アルコキシ-C₁～C₄-アルキル、ヒドロキシ-C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-アルキルスルホニル、ジ(C₁～C₄-アルキル)-アミノスルホニル、C₁～C₆-アルキルカルボニル、または場合によっては置換したフェニルスルホニルまたはベンゾイルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し

【化11】



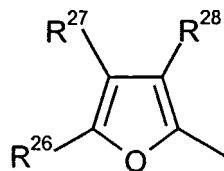
上式で、

R²³およびR²⁴は、互いに独立して、水素、ハロゲン、アミノ、C₁～C₄-アルキル、または1～5個のハロゲン原子を有するC₁～C₄-ハロアルキルを表し、

R²⁵は、水素、ハロゲン、C₁～C₄-アルキル、または1～5個のハロゲン原子を有するC₁～C₄-ハロアルキルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し

【化12】



上式で、

R²⁶およびR²⁷は、互いに独立して、水素、ハロゲン、アミノ、ニトロ、C₁～C₄-アルキル、または1～5個のハロゲン原子を有するC₁～C₄-ハロアルキルを表し、

R²⁸は、水素、ハロゲン、C₁～C₄-アルキル、または1～5個のハロゲン原子を有するC₁～C₄-ハロアルキルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し

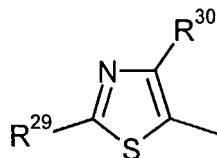
10

20

30

40

【化 1 3】



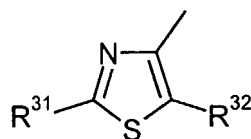
上式で、

R^{29} は、水素、ハロゲン、アミノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノ、ジ - ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) アミノ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、

R^{30} は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し

【化 1 4】



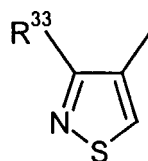
上式で、

R^{31} は、水素、ハロゲン、アミノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノ、ジ - ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) アミノ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、

R^{32} は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し

【化 1 5】

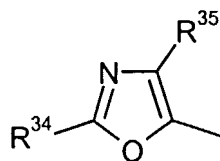


上式で、

R^{33} は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し

【化 1 6】



上式で、

R^{34} は、水素、または $C_1 \sim C_4$ - アルキルを表し、

R^{35} は、ハロゲン、または $C_1 \sim C_4$ - アルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し

10

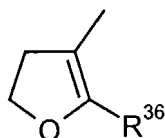
20

30

40

50

【化 1 7】

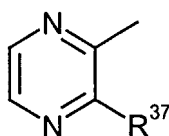


上式で、

R^{36} は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、
あるいは、A は次式の基を表し

10

【化 1 8】



上式で、

R^{37} は、水素、ハロゲン、または $C_1 \sim C_4$ - アルキルを表す]。

【請求項 2】

20

R^1 および R^2 は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルチオを表し、
いずれの場合にも 1 ~ 9 個のフッ素、塩素、および / または臭素原子を有し、

m は 1、2、または 3 を表し、ここで m が 2 または 3 を表す場合、 R^1 は同じ基または異なる基を表し、

n は 1、2、または 3 を表し、ここで n が 2 または 3 を表す場合、 R^2 は同じ基または異なる基を表し、

R^3 は、水素、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_2$ - アルキル、シアノ - $C_1 \sim C_4$ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アミノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルスルフェニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルスルフェニル、($C_1 \sim C_4$ - アルキル)カルボニルを表し、

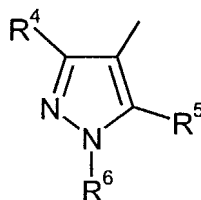
30

Y はカルボニルを表すか、または、場合によっては、フッ素、塩素、臭素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ - ハロアルコキシ、および / または $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルチオ (いずれの場合にも 1 ~ 9 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する) から成る群からの同じ置換基または異なる置換基によって一置換または多置換されている $C_1 \sim C_2$ アルキレンを表し、

40

A は次式の基を表し、

【化 1 9】



上式で、

50

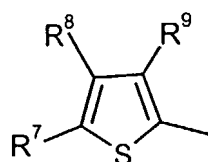
R^4 は、水素、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、*i*-プロピル、1～5個のフッ素原子、塩素原子および/または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、1～5個のフッ素原子、塩素原子および/または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ -ハロアルコキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、アミノカルボニル、アミノカルボニルメチル、またはアミノカルボニルエチルを表し、

R^5 は、水素、フッ素、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、またはエチルチオを表し、

R^6 は、水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、1～5個のフッ素原子、塩素原子および/または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキル、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、またはフェニルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【化20】



20

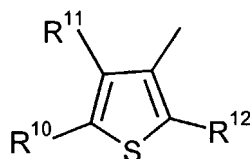
上式で、

R^7 および 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、または1～5個のフッ素原子、塩素原子および/または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルを表し、

R^9 は、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、または1～5個のフッ素原子、塩素原子および/または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ -ハロアルコキシを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【化21】



30

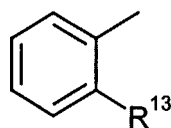
上式で、

R^{10} および R^{11} は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、または1～5個のフッ素原子、塩素原子および/または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルを表し、

R^{12} は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、またはエチルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【化22】



上式で、

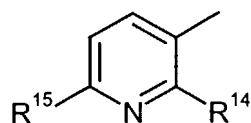
R^{13} は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシル、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、1～5個のフッ素原子、塩素原子および/または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキル、1～5個のフッ素原子、塩素原子および/または臭素原子を有する C_1

50

～C₂ - ハロアルコキシ、または 1 ～ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ～ C₂ - ハロアルキルチオを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 2 3】



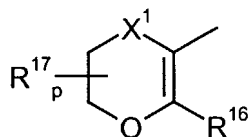
上式で、

R¹⁴ は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、シアノ、C₁ ～ C₄ - アルキル、1 ～ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ～ C₂ - ハロアルキル、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、または 1 ～ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ～ C₂ - ハロアルコキシを表し、

R¹⁵ は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、C₁ ～ C₄ - アルキル、1 ～ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ～ C₂ - ハロアルキル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、1 ～ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ～ C₂ - ハロアルコキシ、C₁ ～ C₂ - アルキルスルフィニル、または C₁ ～ C₂ - アルキルスルホニルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 2 4】



上式で、

R¹⁶ は、メチル、エチル、または 1 ～ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ～ C₂ - ハロアルキルを表し、

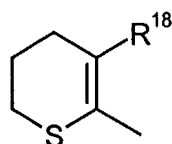
R¹⁷ は、メチル、またはエチルを表し、

X¹ は、硫黄原子を表し、SO、SO₂、または CH₂ を表し、

p は、0、1、または 2 を表し、ここで p が 2 を表す場合、R¹⁷ は同じ基または異なる基を表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 2 5】

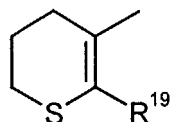


上式で、

R¹⁸ は、メチル、エチル、または 1 ～ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ～ C₂ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 2 6】



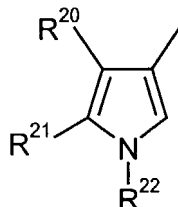
上式で、

R^{19} は、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

10

【化 2 7】



上式で、

R^{20} は、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、i - プロピル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルキルを表し、

20

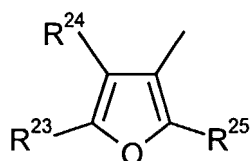
R^{21} は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルキルを表し、

R^{22} は、水素、メチル、エチル、1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_2$ - 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、またはジメチルアミノスルホニルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 2 8】

30



上式で、

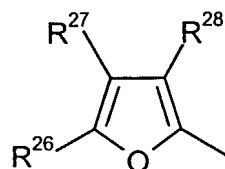
R^{23} および R^{24} は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルキルを表し、

40

R^{25} は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 2 9】



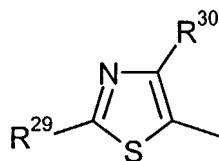
上式で、

R²⁶ および R²⁷ は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、ニトロ、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ~ C₂ - ハロアルキルを表し、

R²⁸ は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ~ C₂ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 3 0】



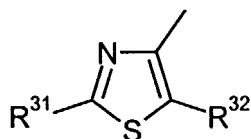
上式で、

R²⁹ は、水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、C₁ ~ C₄ - アルキルアミノ、ジ (C₁ ~ C₄ - アルキル) アミノ、シアノ、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ~ C₂ - ハロアルキルを表し、

R³⁰ は、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ~ C₂ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 3 1】



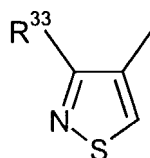
上式で、

R³¹ は、水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、C₁ ~ C₄ - アルキルアミノ、ジ (C₁ ~ C₄ - アルキル) アミノ、シアノ、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ~ C₂ - ハロアルキルを表し、

R³² は、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ~ C₂ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 3 2】



上式で、

10

20

30

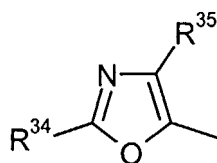
40

50

R^{33} は、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 3 3】



10

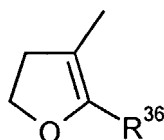
上式で、

R^{34} は、水素、メチル、またはエチルを表し、

R^{35} は、フッ素、塩素、臭素、メチル、またはエチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 3 4】



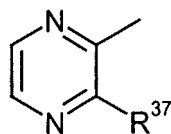
20

上式で、

R^{36} は、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 3 5】



30

上式で、

R^{37} は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、またはエチルを表す請求項 1 に記載の式 (I) のビフェニルカルボキサミド。

【請求項 3】

R^1 および R^2 は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - ブチル、i - ブチル、s - ブチル、t - ブチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、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、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオを表し、

40

m は 1、または 2 を表し、ここで m が 2 を表す場合、 R^1 は同じ基または異なる基を表し、

n は 1、または 2 を表し、ここで n が 2 を表す場合、 R^2 は同じ基または異なる基を表し、

R^3 は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - 、i - 、s - 、t - ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、メトキシ、エトキシ、メトキシメチル、シアノメチル、ジフルオロメチル、メチルスルフェニル、トリクロロメチルスルフェニル、またはアセチルを表し、

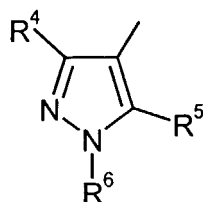
Y は、カルボニルを表し、または、そのそれぞれが、場合によっては、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、i - プロピル、t - ブチル、メトキシ、i - プロポキシ、t - ブ

50

トキシ、メチルチオ、i - プロピルチオ、t - ブチルチオ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、およびトリフルオロメチルチオから成る群からの同じ置換基、または異なる置換基によって一置換から四置換までされている - CH₂ - または - (CH₂)₂ - を表し、

A は、次式の基を表し、

【化 3 6】



10

上式で、

R⁴ は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、i - 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、またはジフルオロメチルチオを表し、

R⁵ は、水素、フッ素、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、またはエチルチオを表し、

20

R⁶ 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、またはフェニルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 3 7】



30

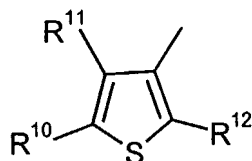
上式で、

R⁷ および R⁸ は、互いに独立して、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、またはトリクロロメチルを表し、

R⁹ 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、またはトリクロロメトキシを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 3 8】



40

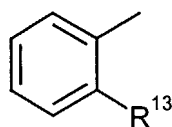
上式で、

R¹⁰ および R¹¹ は、互いに独立して、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、またはトリクロロメチルを表し、

R¹² は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、またはエチルを表し、

50

あるいは、Aは次式の基を表し、
【化39】

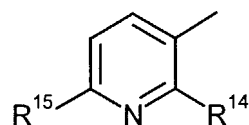


上式で、

R¹³は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシル、シアノ、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-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、トチクロロメチル、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、またはトリクロロメチルチオを表し、

10

あるいは、Aは次式の基を表し、
【化40】



20

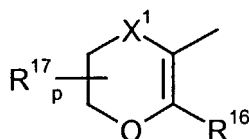
上式で、

R¹⁴は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシル、シアノ、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-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、トチクロロメチル、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、またはトリクロロメトキシを表し、

30

R¹⁵は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-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、トチクロロメチル、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、またはメチルスルホニルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、
【化41】



40

上式で、

R¹⁶は、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

R¹⁷は、メチル、またはエチルを表し、

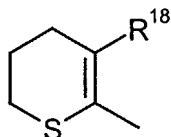
X¹は、硫黄原子を表し、SO、SO₂、またはCH₂を表し、

pは、0、1、または2を表し、ここでpが2を表す場合、R¹⁷は同じ基または異なる基を表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

50

【化 4 2】



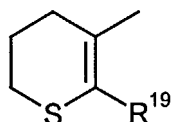
上式で、

R^{18} 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、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

10

【化 4 3】



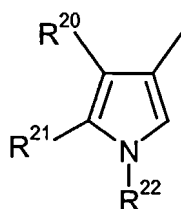
上式で、

R^{19} 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、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

20

【化 4 4】



上式で、

R^{20} は、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、i - 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、またはトリクロロメチルを表し、

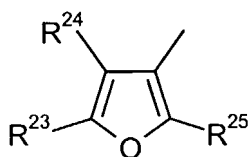
30

R^{21} 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、またはトリクロロメチルを表し、

R^{22} 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、またはヒドロキシエチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 4 5】



40

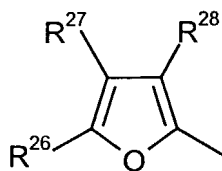
上式で、

R^{23} および R^{24} は、互いに独立して、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、またはトリクロロメチルを表し、

R^{25} 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、またはトリクロロメチルを表し、

50

あるいは、Aは次式の基を表し、
【化46】

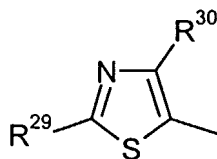


上式で、

R²⁶ および R²⁷ は、互いに独立して、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、またはトリクロロメチルを表し、

R²⁸ 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、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、
【化47】

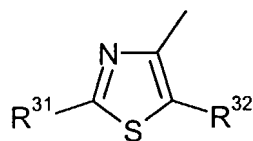


上式で、

R²⁹ 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、またはトリクロロメチルを表し、

R³⁰ は、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、
【化48】

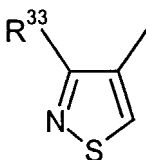


上式で、

R³¹ 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、またはトリクロロメチルを表し、

R³² 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、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、
【化49】



上式で、

10

20

30

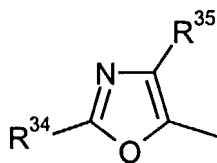
40

50

R^{33} 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、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 5 0】



10

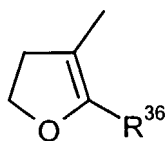
上式で、

R^{34} は、水素、メチル、またはエチルを表し、

R^{35} は、フッ素、塩素、臭素、メチル、またはエチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 5 1】



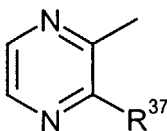
20

上式で、

R^{36} 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、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 5 2】



30

上式で、

R^{37} は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、またはエチルを表す請求項 1 に記載の式 (I) のビフェニルカルボキサミド。

【請求項 4】

R^1 および R^2 は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - ブチル、i - ブチル、s - ブチル、t - ブチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、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、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオを表し、

40

m は 1、または 2 を表し、ここで m が 2 を表す場合、 R^1 は同じ基または異なる基を表し、

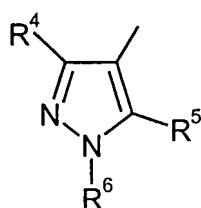
n は 1 を表し、

R^3 は、水素、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - 、i - 、s - 、t - ブチル、シクロプロピル、シクロペンチル、またはシクロヘキシルを表し、

Y は、カルボニルを表し、または、そのそれぞれが、場合によっては、フッ素、メチル、i - プロピル、t - ブチル、メトキシ、i - プロポキシ、t - ブトキシ、メチルチオ、i - プロピルチオ、t - ブチルチオ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、およびトリフルオロメチルチオから成る群からの同じ置換基、または異なる置換基によって一置換から四置換までされている - CH₂ - または - (CH₂)₂ - を表し、

50

A は次式の基を表し、
【化 5 3】



上式で、

10

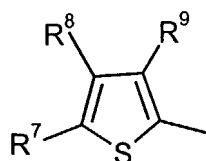
R⁴ は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、i - プロピル、モノフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

R⁵ は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、またはメチルを表し、

R⁶ は、水素、メチル、トリフルオロメチル、またはフェニルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 5 4】



20

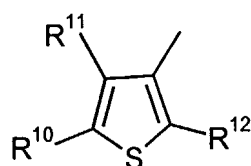
上式で、

R⁷ および R⁸ は、互いに独立して、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、またはトリクロロメチルを表し、

R⁹ は、フッ素、塩素、臭素、メチル、またはトリフルオロメトキシを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 5 5】



30

上式で、

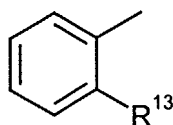
R¹⁰ および R¹¹ は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

R¹² は、水素、フッ素、塩素、臭素、またはメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

40

【化 5 6】

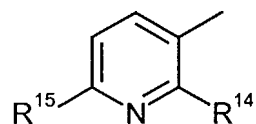


上式で、

R¹³ は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

50

あるいは、Aは次式の基を表し、
【化57】



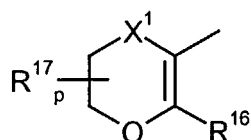
上式で、

R¹⁴は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

10

R¹⁵は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、メチルスルフィニル、またはメチルスルホニルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、
【化58】



20

上式で、

R¹⁶は、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

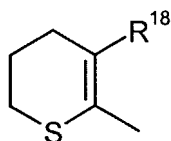
R¹⁷は、メチル、またはエチルを表し、

X¹は、硫黄原子を表し、SO、SO₂、またはCH₂を表し、

pは、0、1、または2を表し、ここでpが2を表す場合、R¹⁷は同じ基または異なる基を表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、
【化59】

30



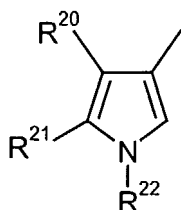
上式で、

R¹⁸は、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【化60】

40

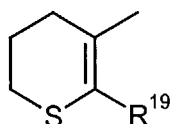


上式で、

R¹⁹は、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

50

あるいは、Aは次式の基を表し、
【化61】



上式で、

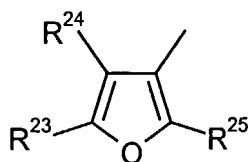
R^{20} は、フッ素、塩素、臭素、メチル、i - プロピル、トリフルオロメチル、ジフル
オロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

10

R^{21} 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、またはトリクロロメチルを表し、

R^{22} は、水素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、またはメトキシメチルを表し

、
あるいは、Aは次式の基を表し、
【化62】



20

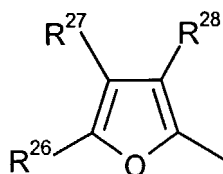
上式で、

R^{23} および R^{24} は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフ
ルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

R^{25} は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチ
ル、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【化63】



30

上式で、

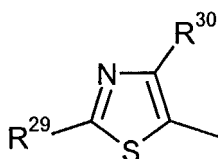
R^{26} および R^{27} は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフ
ルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

R^{28} は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチ
ル、またはトリクロロメチルを表し、

40

あるいは、Aは次式の基を表し、

【化64】



上式で、

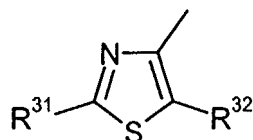
R^{29} は、水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、メチ
ル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

50

R^{30} は、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 6 5】



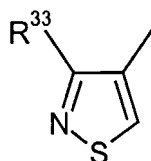
上式で、

R^{31} 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、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

R^{32} は、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 6 6】

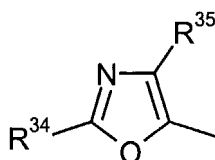


上式で、

R^{33} は、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 6 7】



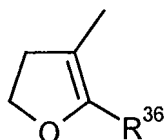
上式で、

R^{34} は、水素、メチル、またはエチルを表し、

R^{35} は、フッ素、塩素、臭素、メチル、またはエチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 6 8】

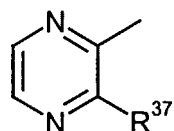


上式で、

R^{36} は、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【化 6 9】



上式で、

R^{37} は、水素、フッ素、塩素、臭素、またはメチルを表す請求項 1 に記載の式 (I) のピフェニルカルボキサミド。

【請求項 5】

10

R^1 は、水素、フッ素、塩素、メチルを表し、

R^2 は、水素を表し、

m は、1 または 2 を表し、ここで m が 2 を表す場合、 R^1 は同じ基または異なる基を表し、

n は、1 を表し、

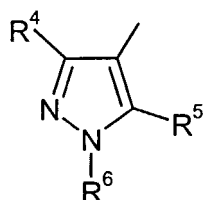
R^3 は、水素を表し、

Y は、 $-CH_2-$ 、 $-(CH_2)_2-$ 、 $-CF_2-$ 、または $-(CF_2)_2-$ を表し、

A は、次式の基を表し、

【化 7 0】

20



上式で、

R^4 は、メチル、モノフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリフルオロメチルを表し、

R^5 は、水素、フッ素、塩素、またはメチルを表し、

R^6 は、メチルを表し、

30

あるいは、 A は次式の基を表し、

【化 7 1】



上式で、

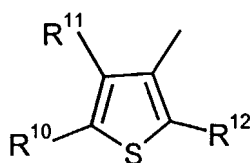
R^7 および R^8 は、水素を表し、

40

R^9 は、メチルを表し、

あるいは、 A は次式の基を表し、

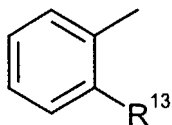
【化 7 2】



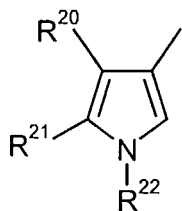
上式で、

50

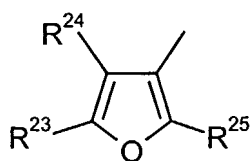
$R^{1\ 0}$ および $R^{1\ 1}$ は、水素を表し、
 $R^{1\ 2}$ は、メチルを表し、
 あるいは、A は次式の基を表し、
 【化 7 3】



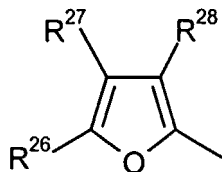
上式で、
 $R^{1\ 3}$ は、ヨウ素、メチル、ジフルオロメチル、またはトリフルオロメチルを表し、
 あるいは、A は次式の基を表し、
 【化 7 4】



上式で、
 $R^{2\ 0}$ は、メチル、トリフルオロメチル、またはジフルオロメチルを表し、
 $R^{2\ 1}$ は、水素、フッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、またはジフルオロメチルを表し、
 $R^{2\ 2}$ は、水素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、またはメトキシメチルを表し、
 あるいは、A は次式の基を表し、
 【化 7 5】

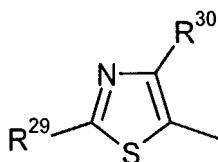


上式で、
 $R^{2\ 3}$ および $R^{2\ 4}$ は、水素を表し、
 $R^{2\ 5}$ は、メチルを表し、
 あるいは、A は次式の基を表し、
 【化 7 6】



上式で、
 $R^{2\ 6}$ および $R^{2\ 7}$ は、水素を表し、
 $R^{2\ 8}$ は、メチルを表し、
 あるいは、A は次式の基を表し、

【化 7 7】



上式で、

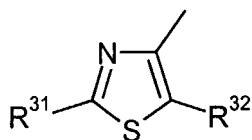
R^{29} は、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、メチル、またはトリフルオロメチルを表し、

R^{30} は、メチル、トリフルオロメチル、またはジフルオロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

10

【化 7 8】



上式で、

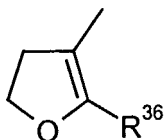
R^{31} は、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、メチル、またはトリフルオロメチルを表し、

R^{32} は、メチル、トリフルオロメチル、またはジフルオロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

20

【化 7 9】



上式で、

R^{36} は、メチル、またはトリフルオロメチルを表す請求項 1 に記載の式 (I) のビフェニルカルボキサミド。 30

【請求項 6】

a) もし触媒がある場合に適しているならば、もし酸結合剤がある場合に適しているならば、およびもし希釈剤がある場合に適しているならば、

式 (II) のカルボン酸誘導体を、

【化 8 0】



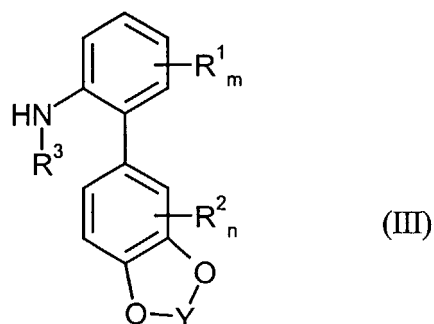
(II)

40

(式中、A は請求項 1 に明示されている通りであり、G はハロゲン、ヒドロキシル、または $C_1 \sim C_6$ - アルコキシを表す)、

式 (III) のアニリン誘導体と反応させる

【化 8 1】



10

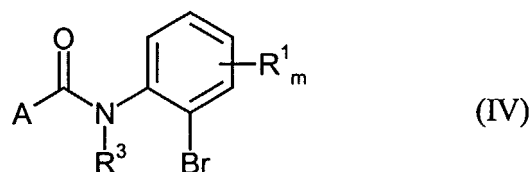
(式中、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 、 R^3 、および Y は請求項1に明示されている通りである)

あるいは、

b) 触媒がある場合、もし酸結合剤がある場合に適しているならば、およびもし希釈剤がある場合に適しているならば、

式(IV)のカルボキサミド誘導体を、

【化 8 2】

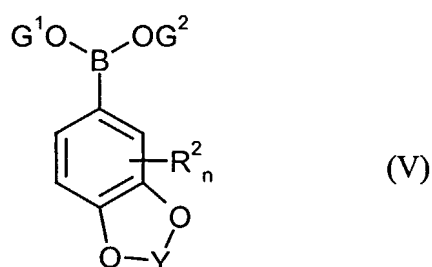


20

(式中、 R^1 、 m 、 R^3 、および A は請求項1に明示されている通りである)、

式(V)のボロン酸誘導体と反応させる

【化 8 3】



30

(式中、 R^2 、 n 、および Y は請求項1に明示されている通りであり、 G^1 および G^2 はそれぞれ水素を表すか、または共にテトラメチルエチレンを表す)、

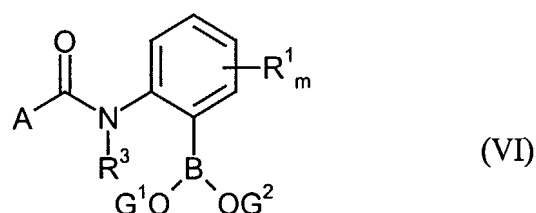
あるいは、

c) 触媒がある場合、もし酸結合剤がある場合に適しているならば、およびもし希釈剤がある場合に適しているならば、

式(VI)のカルボキサミドボロン酸誘導体を、

40

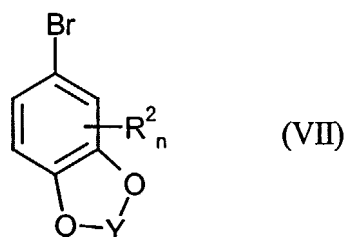
【化 8 4】



(式中、 R^1 、 m 、 R^3 、および A は請求項1に明示されている通りであり、 G^1 および G^2 はそれぞれ水素を表すか、または共にテトラメチルエチレンを表す)、

50

式 (VII) のフェニル誘導体と反応させる
【化 85】

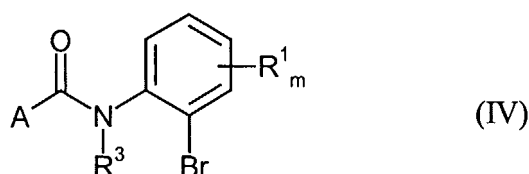


(式中、 R^2 、 n 、および Y は請求項 1 に明示されている通りである)、
あるいは、

10

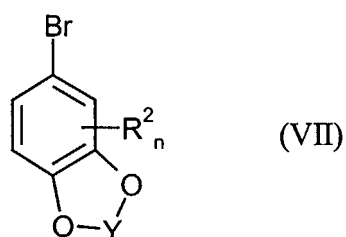
d) パラジウムまたは白金触媒がある場合で、しかも 4, 4', 4', 5, 5, 5', 5' - オクタメチル - 2, 2' - ビス - 1, 3, 2 - ジオキサボロランがある場合、もし酸結合剤がある場合に適しているならば、およびもし希釈剤がある場合に適しているならば、

式 (IV) のカルボキサミド誘導体を
【化 86】



20

(式中、 R^1 、 m 、 R^3 、および A は請求項 1 に明示されている通りである)、
式 (VII) のフェニル誘導体と反応させる
【化 87】



30

(式中、 R^2 、 n 、および Y は請求項 1 に明示されている通りである) ことを特徴とする
請求項 1 に記載の式 (I) のビフェニルカルボキサミドを調製する方法。

【請求項 7】

増量剤および / または界面活性剤に加えて、少なくとも 1 つの請求項 1 に記載の式 (I) のビフェニルカルボキサミドを含むことを特徴とする好ましくない微生物を抑制する組成物。

40

【請求項 8】

好ましくない微生物を抑制するための請求項 1 に記載の式 (I) のビフェニルカルボキサミドの使用。

【請求項 9】

請求項 1 に記載の式 (I) のビフェニルカルボキサミドを微生物および / またはその生息環境に施用することを特徴とする好ましくない微生物を抑制する方法。

【請求項 10】

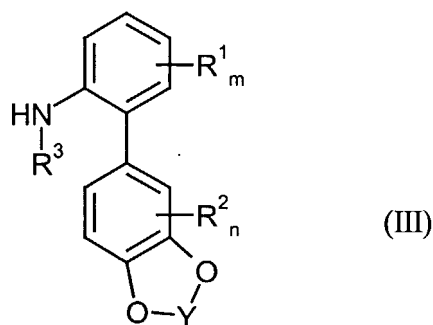
請求項 1 に記載の式 (I) のビフェニルカルボキサミドを増量剤および / または界面活性剤と混合することを特徴とする好ましくない微生物を抑制するための組成物を調製する方法。

50

【請求項 11】

式(III)のアニリン誘導体

【化88】



10

[式中、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 、 R^3 、および Y は請求項1に定義されている通りである

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規なビフェニルカルボキサミド、その調製のための複数の方法、および好ましくない微生物を抑制するのにそれを使うことに関する。

【背景技術】

20

【0002】

多数のカルボキサニリドは殺菌性の特性を有していることはすでに知られている(WO 93/11117、WO 99/09013、WO 0014/071、EP-A 0545099、およびEP-A 05890301を比較されたい)。これらの物質の活性はよい。しかしながら、場合によっては、例えば、散布量が少ないと、不十分な場合もある。

【発明の開示】

【課題を解決するための手段】

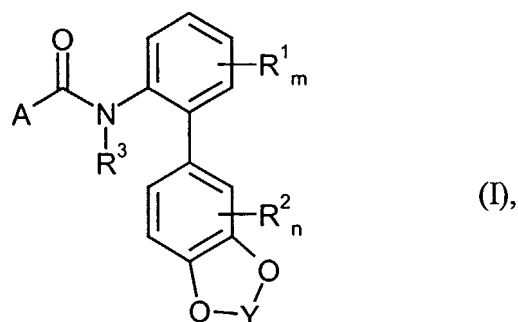
【0003】

今回、本発明は、式(I)の新規なビフェニルカルボキサミド

【0004】

30

【化89】



40

[式中、

R^1 および R^2 は、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_8$ -アルキル、 $C_1 \sim C_8$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ、または $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルチオを表し、いずれの場合にも1~13個のフッ素原子、塩素原子および/または臭素原子を有し、

m は、1、2、3、または4を表し、ここで m が2、3、または4を表す場合、 R^1 は同じ基または異なる基を表し、

n は、1、2、または3を表し、ここで n が2または3を表す場合、 R^2 は同じ基または異なる基を表し、

R^3 は、水素、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、

50

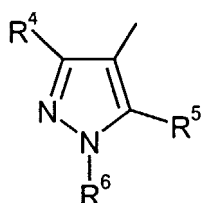
$C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、シアノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、1 ~ 7 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルスルフェニル、1 ~ 7 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルスルフェニル、($C_1 \sim C_6$ - アルキル)カルボニル、カルバモイルを表し、

Y は、カルボニルを表し、または、場合によっては、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシ、および / または $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルチオ (いずれの場合にも 1 ~ 13 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する) から成る群からの同じ置換基または異なる置換基によって一置換または多置換されている $C_1 \sim C_3$ - アルキレンを表し、

A は次式の基を表し

【0005】

【化90】



20

上式で、

R^4 は、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルチオ、アミノカルボニル、またはアミノカルボニル - $C_1 \sim C_4$ - アルキルを表し、

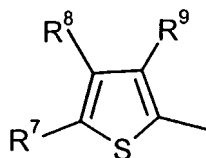
R^5 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、または $C_1 \sim C_4$ - アルキルチオを表し、

R^6 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキル、ヒドロキシ - $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルチオ - $C_1 \sim C_4$ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルチオ - $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_4$ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルコキシ - $C_1 \sim C_4$ - アルキル、またはフェニルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し

【0006】

【化91】



40

上式で、

R^7 および R^8 は、互いに独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、

R^9 は、水素、シアノ、または $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルコキシを表し、

あるいは、A は次式の基を表し

【0007】

50

【化 9 2】



上式で、

R¹⁰ および R¹¹ は、互いに独立して、水素、ハロゲン、C₁ ~ C₄ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ ~ C₄ - ハロアルキルを表し、

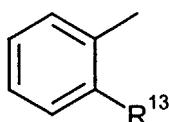
R¹² は、水素、C₁ ~ C₄ - アルキル、またはハロゲンを表し、

あるいは、A は次式の基を表し

10

【0008】

【化 9 3】



上式で、

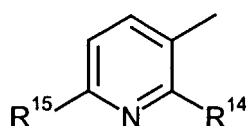
R¹³ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、C₁ ~ C₆ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ ~ C₄ - ハロアルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ ~ C₄ - ハロアルコキシ、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ ~ C₄ - ハロアルキルチオを表し、

あるいは、A は次式の基を表し

20

【0009】

【化 9 4】



30

上式で、

R¹⁴ は、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、C₁ ~ C₄ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ ~ C₄ - ハロアルキル、C₁ ~ C₄ - アルコキシ、C₁ ~ C₄ - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ ~ C₄ - ハロアルキルチオ、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ ~ C₄ - ハロアルコキシを表し、

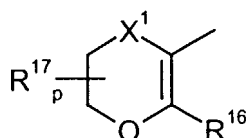
R¹⁵ は、水素、ハロゲン、シアノ、C₁ ~ C₄ - アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ ~ C₄ - ハロアルキル、C₁ ~ C₄ - アルコキシ、C₁ ~ C₄ - アルキルチオ、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ ~ C₄ - ハロアルコキシ、C₁ ~ C₄ - アルキルスルフィニル、または C₁ ~ C₄ - アルキルスルホニルを表し、

40

あるいは、A は次式の基を表し

【0010】

【化 9 5】



上式で、

50

R^{16} は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、

R^{17} は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルを表し、

X^1 は、硫黄原子を表し、 SO 、 SO_2 、または CH_2 を表し、

p は、0、1、または 2 を表し、ここで p が 2 を表す場合、 R^{17} は同じ基または異なる基を表し、

あるいは、 A は次式の基を表し

【0011】

【化96】



10

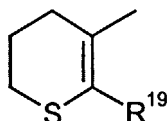
上式で、

R^{18} は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、

あるいは、 A は次式の基を表し

【0012】

【化97】



20

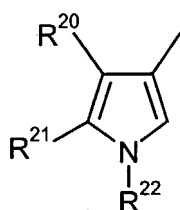
上式で、

R^{19} は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、

あるいは、 A は次式の基を表し

【0013】

【化98】



30

上式で、

R^{20} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、 40

R^{21} は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、

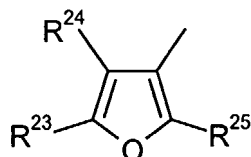
R^{22} は、水素、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_4$ - アルキル、ヒドロキシ - $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルスルホニル、ジ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) - アミノスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルカルボニル、または場合によっては置換したフェニルスルホニルまたはベンゾイルを表し、

あるいは、 A は次式の基を表し

【0014】

50

【化 9 9】



上式で、

R²³ および R²⁴ は、互いに独立して、水素、ハロゲン、アミノ、C₁ ~ C₄ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ ~ C₄ - ハロアルキルを表し、

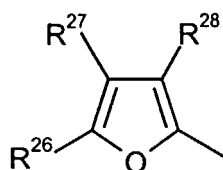
10

R²⁵ は、水素、ハロゲン、C₁ ~ C₄ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ ~ C₄ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し

【0015】

【化100】



20

上式で、

R²⁶ および R²⁷ は、互いに独立して、水素、ハロゲン、アミノ、ニトロ、C₁ ~ C₄ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ ~ C₄ - ハロアルキルを表し、

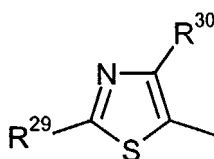
R²⁸ は、水素、ハロゲン、C₁ ~ C₄ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ ~ C₄ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し

【0016】

【化101】

30



上式で、

R²⁹ は、水素、ハロゲン、アミノ、C₁ ~ C₄ - アルキルアミノ、ジ - (C₁ ~ C₄ - アルキル) アミノ、シアノ、C₁ ~ C₄ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ ~ C₄ - ハロアルキルを表し、

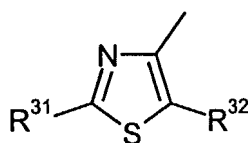
R³⁰ は、ハロゲン、C₁ ~ C₄ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する C₁ ~ C₄ - ハロアルキルを表し、

40

あるいは、A は次式の基を表し

【0017】

【化102】



上式で、

50

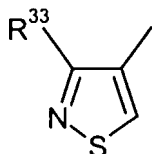
R^{31} は、水素、ハロゲン、アミノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノ、ジ - ($C_1 \sim C_4$ - アルキル) アミノ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、

R^{32} は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し

【0018】

【化103】



10

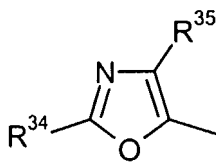
上式で、

R^{33} は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し

【0019】

【化104】



20

上式で、

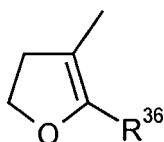
R^{34} は、水素、または $C_1 \sim C_4$ - アルキルを表し、

R^{35} は、ハロゲン、または $C_1 \sim C_4$ - アルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し

【0020】

【化105】



30

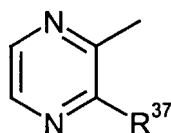
上式で、

R^{36} は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、または 1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し

【0021】

【化106】



40

上式で、

R^{37} は、水素、ハロゲン、または $C_1 \sim C_4$ - アルキルを表す] を提供する。

50

置換基の性質によっては、式（Ⅰ）の化合物は、幾何異性体および／または光学異性体、またはいろいろな組成の異性体混合物として示すことも可能である。本発明は、純粋な異性体の使用、および異性体混合物の使用の両方に関する。

【 0 0 2 2 】

さらに、式（Ⅰ）のビフェニルカルボキサミドは、

a) もし触媒がある場合に適しているならば、もし酸結合剤がある場合に適しているならば、およびもし希釈剤がある場合に適しているならば、

式（ⅠⅠ）のカルボン酸誘導体を、

【 0 0 2 3 】

【 化 1 0 7 】



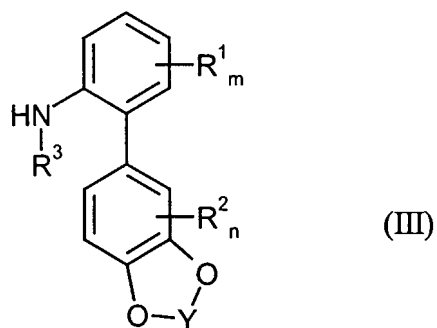
10

（式中、Aは上記に明示されている通りであり、Gはハロゲン、ヒドロキシル、またはC₁～C₆-アルコキシを表す）、

式（ⅠⅠⅠ）のアニン誘導体と反応させる

【 0 0 2 4 】

【 化 1 0 8 】



20

（式中、R¹、R²、m、n、R³、およびYは上記に明示されている通りである）とき 30
に、

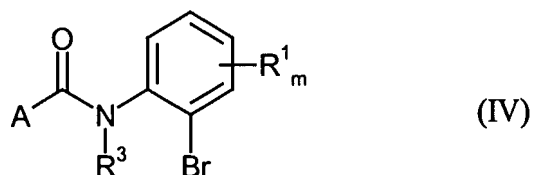
あるいは、

b) 触媒がある場合、もし酸結合剤がある場合に適しているならば、およびもし希釈剤がある場合に適しているならば、

式（ⅠⅤ）のカルボキサミド誘導体を、

【 0 0 2 5 】

【 化 1 0 9 】



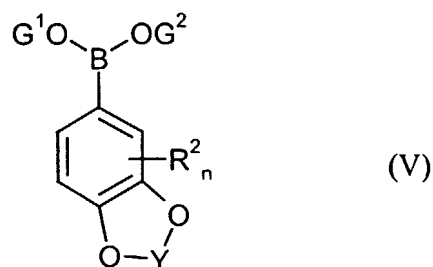
40

（式中、R¹、m、R³、およびAは上記に明示されている通りである）、

式（Ⅴ）のボロン酸誘導体と反応させる

【 0 0 2 6 】

【化 1 1 0】



(式中、 R^2 、 n 、および Y は上記に明示されている通りであり、 G^1 および G^2 はそれぞれ水素を表すか、または共にテトラメチルエチレンを表す)ときに、

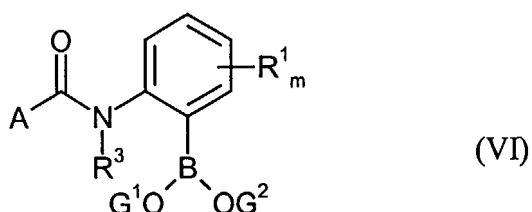
あるいは、

c) 触媒がある場合、もし酸結合剤がある場合に適しているならば、およびもし希釈剤がある場合に適しているならば、

式(VI)のカルボキサミドボロン酸誘導体を、

【0 0 2 7】

【化 1 1 1】

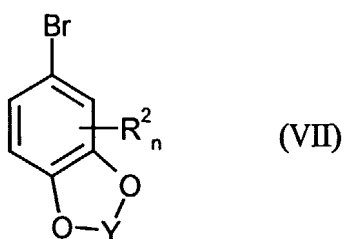


(式中、 R^1 、 m 、 R^3 、および A は上記に明示されている通りであり、 G^1 および G^2 はそれぞれ水素を表すか、または共にテトラメチルエチレンを表す)、

式(VII)のフェニル誘導体と反応させる

【0 0 2 8】

【化 1 1 2】



(式中、 R^2 、 n 、および Y は上記に明示されている通りである)ときに、

あるいは、

d) パラジウムまたは白金触媒がある場合で、しかも4, 4', 5, 5', 5'-オクタメチル-2, 2'-ビス-1, 3, 2-ジオキサボロランがある場合、もし酸結合剤がある場合に適しているならば、およびもし希釈剤がある場合に適しているならば、

式(IV)のカルボキサミド誘導体を

【0 0 2 9】

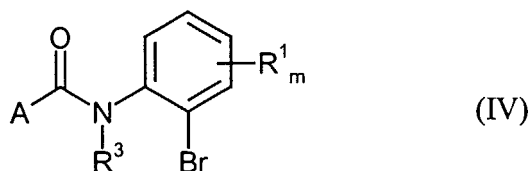
10

20

30

40

【化 1 1 3】

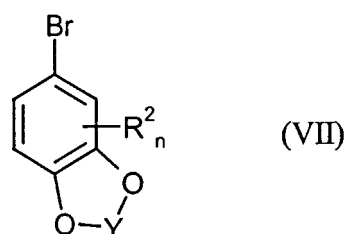


(式中、 R^1 、 m 、 R^3 、および A は上記に明示されている通りである)、
式 (VII) のフェニル誘導体と反応させる

10

【0030】

【化 1 1 4】



(式中、 R^2 、 n 、および Y は上記に明示されている通りである) ときに得られること
が分かっている。

20

【0031】

最後に、式 (I) の新規なビフェニルカルボキサミドは非常に良好な殺菌剤特性を有し
ており、作物の保護および材料の保護の両方において好ましくない微生物を抑制するの
に使うことができることが分かっている。

【0032】

驚いたことには、本発明による式 (I) のビフェニルカルボキサミドは、同じ方面の作
用を有している従来技術の構造上非常に似ている活性化合物よりも、良い殺菌活性を有し
ている。

【0033】

30

式 (I) は、本発明によるビフェニルカルボキサミドの一般的な定義を表示している。

【発明を実施するための最良の形態】

【0034】

R^1 および R^2 は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルチオを表し、
いずれの場合にも 1 ~ 9 個のフッ素、塩素、および / または臭素原子を有し、

m は 1、2、または 3 を表し、ここで m が 2 または 3 を表す場合、 R^1 は同じ基または
異なる基を表し、

n は 1、2、または 3 を表し、ここで n が 2 または 3 を表す場合、 R^2 は同じ基または
異なる基を表し、

40

R^3 は、水素、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、
 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_2$ -アルキル、シアノ- $C_1 \sim C_4$ -
アルキル、1 ~ 5 個のハロゲン原子を有する $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -
アミノアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルフェニル、1 ~ 5 個のハロゲン原子
を有する $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルスルフェニル、($C_1 \sim C_4$ -アルキル)カルボニル
を表し、

Y はカルボニルを表すか、または、場合によっては、フッ素、塩素、臭素、 $C_1 \sim C_4$ -
アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロア
ルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、および / または $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルチオ (

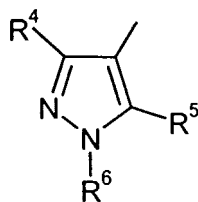
50

いずれの場合にも 1 ~ 9 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する) から成る群からの同じ置換基または異なる置換基によって一置換または多置換されている $C_1 \sim C_2$ アルキレンを表し、

A は次式の基を表し、

【 0 0 3 5 】

【 化 1 1 5 】



10

上式で、

R^4 は、水素、シアノ、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、i - プロピル、1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルキル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルコキシ、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、またはアミノカルボニルエチルを表し、

20

R^5 は、水素、フッ素、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、またはエチルチオを表し、

R^6 は、水素、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルキル、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、またはフェニルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【 0 0 3 6 】

【 化 1 1 6 】



30

上式で、

R^7 および 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、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルキルを表し、

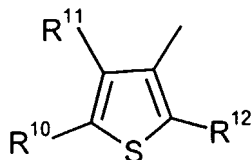
R^9 は、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルコキシを表し、

40

あるいは、A は次式の基を表し、

【 0 0 3 7 】

【 化 1 1 7 】



50

上式で、

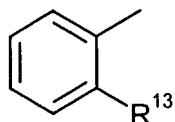
R^{10} および R^{11} は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルキルを表し、

R^{12} は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、またはエチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【0038】

【化118】



10

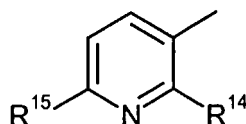
上式で、

R^{13} は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシル、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルキル、1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルコキシ、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルキルチオを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【0039】

【化119】



20

上式で、

R^{14} は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルキル、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、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルコキシを表し、

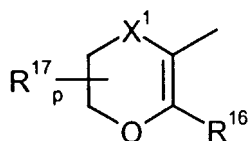
30

R^{15} は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルキル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ - アルキルスルフィニル、または $C_1 \sim C_2$ - アルキルスルホニルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【0040】

【化120】



40

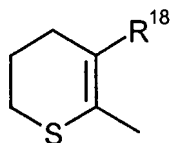
上式で、

R^{16} は、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ - ハロアルキルを表し、

R^{17} は、メチル、またはエチルを表し、

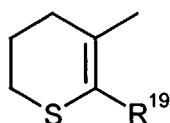
50

X^1 は、硫黄原子を表し、 SO 、 SO_2 、または CH_2 を表し、
 p は、0、1、または2を表し、ここで p が2を表す場合、 R^{1-7} は同じ基または異なる基を表し、
 あるいは、 A は次式の基を表し、
 【0041】
 【化121】



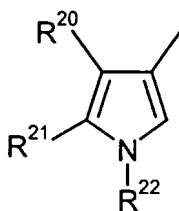
10

上式で、
 R^{1-8} は、メチル、エチル、または1～5個のフッ素原子、塩素原子および/または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルを表し、
 あるいは、 A は次式の基を表し、
 【0042】
 【化122】



20

上式で、
 R^{1-9} は、メチル、エチル、または1～5個のフッ素原子、塩素原子および/または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルを表し、
 あるいは、 A は次式の基を表し、
 【0043】
 【化123】



30

上式で、
 R^{2-10} は、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、*i*-プロピル、または1～5個のフッ素原子、塩素原子および/または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルを表し、
 R^{2-11} は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、または1～5個のフッ素原子、塩素原子および/または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルを表し、
 R^{2-12} は、水素、メチル、エチル、1～5個のフッ素原子、塩素原子および/または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_2$ -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、またはジメチルアミノスルホニルを表し、
 あるいは、 A は次式の基を表し、
 【0044】

40

【化 1 2 4】



上式で、

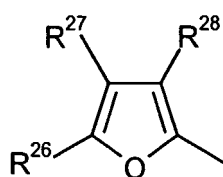
R²³ および R²⁴ は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ~ C₂ - ハロアルキルを表し、

R²⁵ は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ~ C₂ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【0 0 4 5】

【化 1 2 5】



20

上式で、

R²⁶ および R²⁷ は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、ニトロ、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ~ C₂ - ハロアルキルを表し、

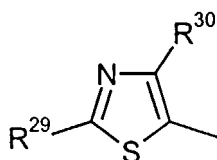
R²⁸ は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ~ C₂ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

30

【0 0 4 6】

【化 1 2 6】



上式で、

R²⁹ は、水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、C₁ ~ C₄ - アルキルアミノ、ジ (C₁ ~ C₄ - アルキル) アミノ、シアノ、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ~ C₂ - ハロアルキルを表し、

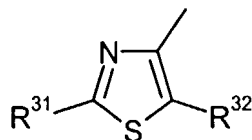
R³⁰ は、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、または 1 ~ 5 個のフッ素原子、塩素原子および / または臭素原子を有する C₁ ~ C₂ - ハロアルキルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【0 0 4 7】

40

【化 1 2 7】



上式で、

R^{31} は、水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノ、ジ($C_1 \sim C_4$ -アルキル)アミノ、シアノ、メチル、エチル、または1～5個のフッ素原子、塩素原子および/または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルを表し、

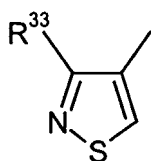
10

R^{32} は、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、または1～5個のフッ素原子、塩素原子および/または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【0 0 4 8】

【化 1 2 8】



20

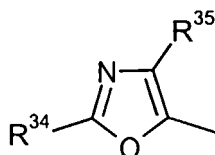
上式で、

R^{33} は、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、または1～5個のフッ素原子、塩素原子および/または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【0 0 4 9】

【化 1 2 9】



30

上式で、

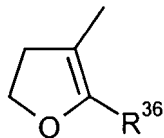
R^{34} は、水素、メチル、またはエチルを表し、

R^{35} は、フッ素、塩素、臭素、メチル、またはエチルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【0 0 5 0】

【化 1 3 0】



40

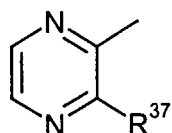
上式で、

R^{36} は、メチル、エチル、または1～5個のフッ素原子、塩素原子および/または臭素原子を有する $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【0 0 5 1】

【化 1 3 1】



上式で、

R^{37} は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、またはエチルを表す式 (I) のピフェニルカルボキサミドが好ましい。

【0052】

R^1 および R^2 は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、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、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオを表し、

m は 1、または 2 を表し、ここで *m* が 2 を表す場合、 R^1 は同じ基または異なる基を表し、

n は 1、または 2 を表し、ここで *n* が 2 を表す場合、 R^2 は同じ基または異なる基を表し、

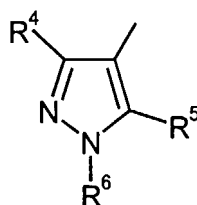
R^3 は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-、*i*-、*s*-、*t*-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、メトキシ、エトキシ、メトキシメチル、シアノメチル、ジフルオロメチル、メチルスルフェニル、トリクロロメチルスルフェニル、またはアセチルを表し、

Y は、カルボニルを表し、または、そのそれぞれが、場合によっては、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、*i*-プロピル、*t*-ブチル、メトキシ、*i*-プロポキシ、*t*-ブトキシ、メチルチオ、*i*-プロピルチオ、*t*-ブチルチオ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、およびトリフルオロメチルチオから成る群からの同じ置換基、または異なる置換基によって一置換から四置換までされている $-CH_2-$ または $-(CH_2)_2-$ を表し、

A は、次式の基を表し、

【0053】

【化 1 3 2】



上式で、

R^4 は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、*i*-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、またはジフルオロメチルチオを表し、

R^5 は、水素、フッ素、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、またはエチルチオを表し、

R^6 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、またはフェニルを表し、

あるいは、*A* は次式の基を表し、

【 0 0 5 4 】

【 化 1 3 3 】



上式で、

R⁷ および R⁸ は、互いに独立して、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、またはトリクロロメチルを表し、

R⁹ 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、またはトリクロロメトキシを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【 0 0 5 5 】

【 化 1 3 4 】



20

上式で、

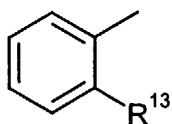
R¹⁰ および R¹¹ は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

R¹² は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、またはエチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【 0 0 5 6 】

【 化 1 3 5 】



30

上式で、

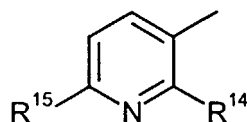
R¹³ は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシル、シアノ、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - ブチル、i - ブチル、s - ブチル、t - ブチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、トチクロロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、ジフルオロクロロメチルチオ、またはトリクロロメチルチオを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【 0 0 5 7 】

40

【化 1 3 6】



上式で、

R^{14} は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、ヒドロキシル、シアノ、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチル、*t*-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、トチクロロメチル、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、またはトリクロロメトキシを表し、

10

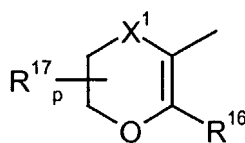
R^{15} は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、トチクロロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、メチルスルフィニル、またはメチルスルホニルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【0058】

20

【化 1 3 7】



上式で、

R^{16} 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、またはトリクロロメチルを表し、

R^{17} は、メチル、またはエチルを表し、

30

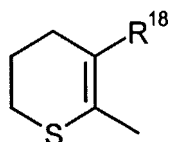
X^1 は、硫黄原子を表し、 SO 、 SO_2 、または CH_2 を表し、

p は、0、1、または2を表し、ここで p が2を表す場合、 R^{17} は同じ基または異なる基を表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【0059】

【化 1 3 8】



40

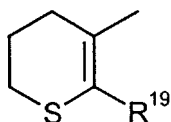
上式で、

R^{18} 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、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【0060】

【化 1 3 9】



上式で、

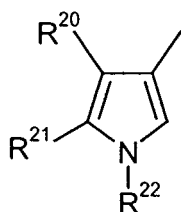
R^{19} は、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

10

【0 0 6 1】

【化 1 4 0】



上式で、

20

R^{20} は、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、i - 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、またはトリクロロメチルを表し、

R^{21} 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、またはトリクロロメチルを表し、

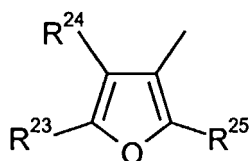
R^{22} は、水素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシメチル、エトキシメチル、ヒドロキシメチル、またはヒドロキシエチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【0 0 6 2】

【化 1 4 1】

30



上式で、

R^{23} および R^{24} は、互いに独立して、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、またはトリクロロメチルを表し、

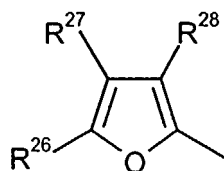
40

R^{25} 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、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【0 0 6 3】

【化 1 4 2】



上式で、

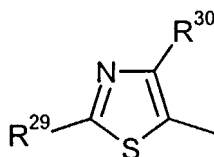
R^{26} および R^{27} は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、ニトロ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

R^{28} 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、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【0064】

【化 1 4 3】



上式で、

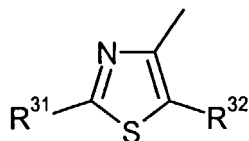
R^{29} は、水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、シアノ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

R^{30} は、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【0065】

【化 1 4 4】



上式で、

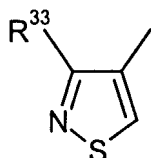
R^{31} は、水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、シアノ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

R^{32} 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、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【0066】

【化 1 4 5】

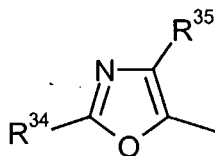


上式で、

R^{33} 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、またはトリクロロメチルを表し、
あるいは、A は次式の基を表し、

【0067】

【化146】



10

上式で、

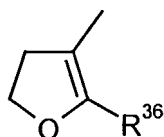
R^{34} は、水素、メチル、またはエチルを表し、

R^{35} は、フッ素、塩素、臭素、メチル、またはエチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【0068】

【化147】



20

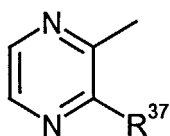
上式で、

R^{36} 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、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【0069】

【化148】



30

上式で、

R^{37} は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、またはエチルを表す式 (I) のピフェニルカルボキサミドが特に好ましい。

【0070】

R^1 および R^2 は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - ブチル、i - ブチル、s - ブチル、t - ブチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、エチルチオ、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、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオを表し、

m は 1、または 2 を表し、ここで m が 2 を表す場合、 R^1 は同じ基または異なる基を表し、

n は 1 を表し、

R^3 は、水素、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - 、i - 、s - 、t - ブチル、シクロプロピル、シクロペンチル、またはシクロヘキシルを表し、

Y は、カルボニルを表し、または、そのそれぞれが、場合によっては、フッ素、メチル、i - プロピル、t - ブチル、メトキシ、i - プロピルチオ、t - ブチルチオ、メチルチオ、i - プロピルチオ、t - ブチルチオ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、およ

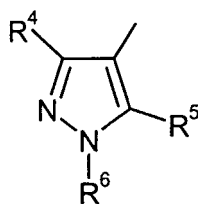
50

びトリフルオロメチルチオから成る群からの同じ置換基、または異なる置換基によって一置換から四置換までされている -CH₂- または -(CH₂)₂- を表し、

A は次式の基を表し、

【 0 0 7 1 】

【 化 1 4 9 】



10

上式で、

R⁴ は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、i-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、またはトリクロロメチルを表し、

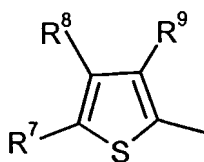
R⁵ は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、またはメチルを表し、

R⁶ は、水素、メチル、トリフルオロメチル、またはフェニルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【 0 0 7 2 】

【 化 1 5 0 】



20

上式で、

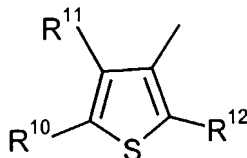
R⁷ および R⁸ は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

R⁹ は、フッ素、塩素、臭素、メチル、またはトリフルオロメトキシを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【 0 0 7 3 】

【 化 1 5 1 】



40

上式で、

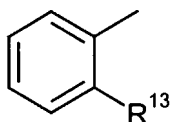
R¹⁰ および R¹¹ は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

R¹² は、水素、フッ素、塩素、臭素、またはメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【 0 0 7 4 】

【化 1 5 2】



上式で、

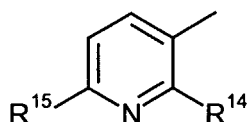
R^{13} は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

10

【0 0 7 5】

【化 1 5 3】



上式で、

R^{14} は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

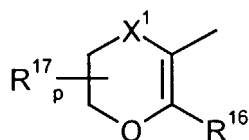
20

R^{15} は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、n - プロピル、i - プロピル、n - ブチル、i - ブチル、s - ブチル、t - ブチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、メチルスルフィニル、またはメチルスルホニルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【0 0 7 6】

【化 1 5 4】



30

上式で、

R^{16} は、メチル、エチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

R^{17} は、メチル、またはエチルを表し、

X^1 は、硫黄原子を表し、SO、SO₂、またはCH₂を表し、

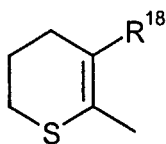
p は、0、1、または2を表し、ここで p が2を表す場合、 R^{17} は同じ基または異なる基を表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

40

【0 0 7 7】

【化 1 5 5】



上式で、

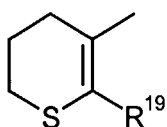
R^{18} は、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

50

【 0 0 7 8 】

【 化 1 5 6 】



上式で、

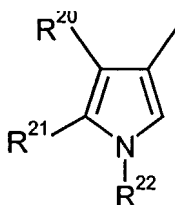
R^{19} は、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

10

あるいは、Aは次式の基を表し、

【 0 0 7 9 】

【 化 1 5 7 】



20

上式で、

R^{20} は、フッ素、塩素、臭素、メチル、i - プロピル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

R^{21} 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、またはトリクロロメチルを表し、

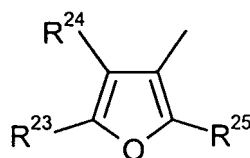
R^{22} は、水素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、またはメトキシメチルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【 0 0 8 0 】

【 化 1 5 8 】

30



上式で、

R^{23} および R^{24} は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

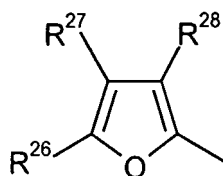
R^{25} は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

40

あるいは、Aは次式の基を表し、

【 0 0 8 1 】

【 化 1 5 9 】



50

上式で、

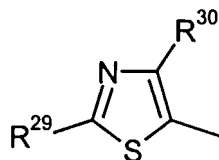
R^{26} および R^{27} は、互いに独立して、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

R^{28} は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【0082】

【化160】



10

上式で、

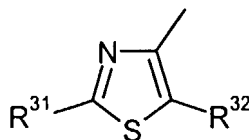
R^{29} は、水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

R^{30} は、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【0083】

【化161】



20

上式で、

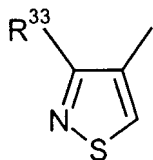
R^{31} は、水素、フッ素、塩素、臭素、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

R^{32} は、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【0084】

【化162】



30

40

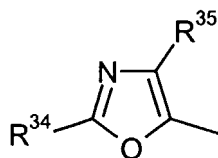
上式で、

R^{33} は、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【0085】

【化 1 6 3】



上式で、

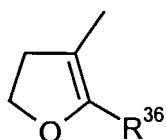
R³⁴ は、水素、メチル、またはエチルを表し、R³⁵ は、フッ素、塩素、臭素、メチル、またはエチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

10

【0 0 8 6】

【化 1 6 4】



上式で、

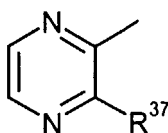
R³⁶ は、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリクロロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

20

【0 0 8 7】

【化 1 6 5】



上式で、

R³⁷ は、水素、フッ素、塩素、臭素、またはメチルを表す式 (I) のビフェニルカルボキサミドが非常に特に好ましい。

30

【0 0 8 8】

R¹ は、水素、フッ素、塩素、メチルを表し、R² は、水素を表し、m は、1 または 2 を表し、ここで m が 2 を表す場合、R¹ は同じ基または異なる基を表し、

n は、1 を表し、

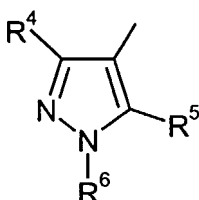
R³ は、水素を表し、Y は、-CH₂-、-(CH₂)₂-、-CF₂-、または-(CF₂)₂-を表し、

40

A は、次式の基を表し、

【0 0 8 9】

【化 1 6 6】



50

上式で、

R^4 は、メチル、モノフルオロメチル、ジフルオロメチル、またはトリフルオロメチルを表し、

R^5 は、水素、フッ素、塩素、またはメチルを表し、

R^6 は、メチルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【0090】

【化167】



10

上式で、

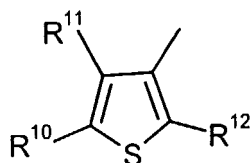
R^7 および R^8 は、水素を表し、

R^9 は、メチルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【0091】

【化168】



20

上式で、

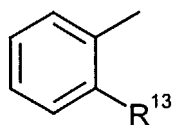
R^{10} および R^{11} は、水素を表し、

R^{12} は、メチルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【0092】

【化169】



30

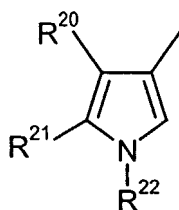
上式で、

R^{13} は、ヨウ素、メチル、ジフルオロメチル、またはトリフルオロメチルを表し、

あるいは、Aは次式の基を表し、

【0093】

【化170】



40

上式で、

R^{20} は、メチル、トリフルオロメチル、またはジフルオロメチルを表し、

50

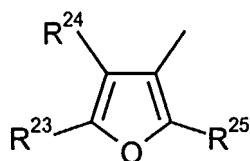
$R^{2\ 1}$ は、水素、フッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、またはジフルオロメチルを表し、

$R^{2\ 2}$ は、水素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、またはメトキシメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【 0 0 9 4 】

【 化 1 7 1 】



10

上式で、

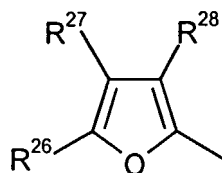
$R^{2\ 3}$ および $R^{2\ 4}$ は、水素を表し、

$R^{2\ 5}$ は、メチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【 0 0 9 5 】

【 化 1 7 2 】



20

上式で、

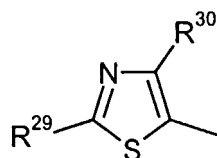
$R^{2\ 6}$ および $R^{2\ 7}$ は、水素を表し、

$R^{2\ 8}$ は、メチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【 0 0 9 6 】

【 化 1 7 3 】



30

上式で、

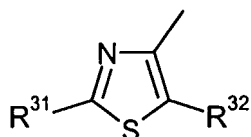
$R^{2\ 9}$ は、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、メチル、またはトリフルオロメチルを表し、 40

$R^{3\ 0}$ は、メチル、トリフルオロメチル、またはジフルオロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【 0 0 9 7 】

【 化 1 7 4 】



50

上式で、

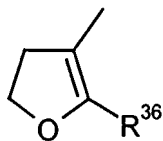
$R^{3\ 1}$ は、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、メチル、またはトリフルオロメチルを表し、

$R^{3\ 2}$ は、メチル、トリフルオロメチル、またはジフルオロメチルを表し、

あるいは、A は次式の基を表し、

【0098】

【化175】



10

上式で、

$R^{3\ 6}$ は、メチル、またはトリフルオロメチルを表す式 (I) のビフェニルカルボキサミドが特に好ましい。

【0099】

さらに、 R^3 が水素を表している式 (I) の化合物が注目される。

【0100】

さらに、 R^2 が水素を表している式 (I) の化合物が注目される。

【0101】

さらに、Y が $-CH_2-$ 、 $-(CH_2)_2-$ 、 $-CF_2-$ 、または $-(CF_2)_2-$ を表している式 (I) の化合物が注目される。

20

【0102】

さらに、 R^1 が水素、フッ素、塩素、またはメチルを、特に水素またはフッ素を表している式 (I) の化合物が注目される。

【0103】

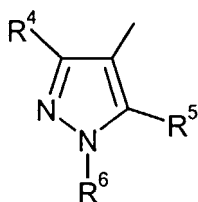
さらに、m が 0、1、または 2 を表している式 (I) の化合物が注目される。

【0104】

さらに、A が次式の基を表している式 (I) の化合物が注目される。

【0105】

【化176】



上式で、 R^4 、 R^5 、および R^6 は上記に明示されている通りである。

【0106】

さらに、A が次式の基を表している式 (I) の化合物が注目される。

40

【0107】

【化177】



上式で、 R^7 、 R^8 、および R^9 は上記に明示されている通りである。

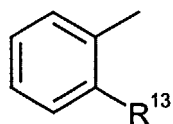
【0108】

50

さらに、A が次式の基を表している式 (I) の化合物が注目される。

【0109】

【化178】



上式で、 R^{13} は上記に明示されている通りである。

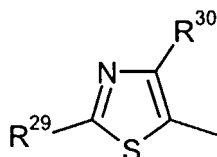
【0110】

10

さらに、A が次式の基を表している式 (I) の化合物が注目される。

【0111】

【化179】



上式で、 R^{29} 、および R^{30} は上記に明示されている通りである。

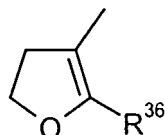
【0112】

20

さらに、A が次式の基を表している式 (I) の化合物が注目される。

【0113】

【化180】



上式で、 R^{36} は上記に明示されている通りである。

【0114】

30

アルキルまたはアルケニルなどの飽和した、または未飽和の炭化水素基は、いずれの場合にも、例えば、アルコキシにあるようなヘテロ原子と結合してさえ、可能である限り、直鎖である、または枝分かれしていることができる。

【0115】

場合によっては、置換された基は、一置換または多置換であることも可能であり、多置換の場合、置換基は同じであることも、異なることも可能である。

【0116】

例えば、ハロアルキルのようなハロゲン置換した基は、一ハロゲン化、または多ハロゲン化している。多ハロゲン化の場合、そのハロゲン原子は、同じであることも、異なることも可能である。ここで、ハロゲンはフッ素、塩素、臭素、およびヨウ素を表し、特にフッ素、塩素、および臭素を表す。

40

【0117】

しかしながら、上記に記載された一般的な、または好ましい基の定義または例示も、要望どおり互いに組み合わせる、すなわち、それぞれの範囲から好ましい範囲の間の組合せを含むことができる。それらの組合せは、最終生成物、および相応して、前駆体および中間体に適用される。さらに、個々の定義は適用できないかもしれない。

【0118】

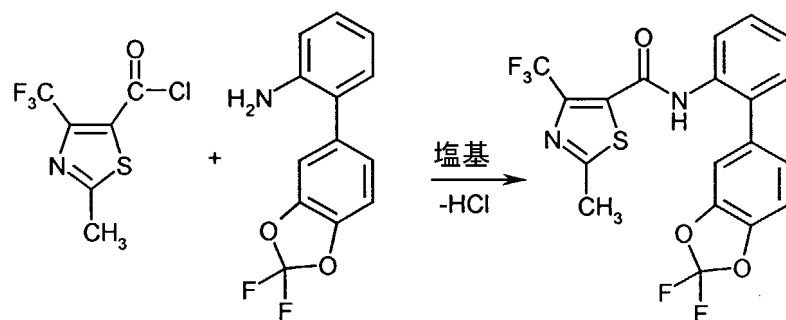
出発物質として 2 - メチル - 4 - トリフルオロメチル - 1, 3 - チアゾール - 5 - カルボニルクロライド、および (2, 2 - ジフルオロ - 1, 3 - ベンゾジオキソル - 5 - イル) フェニルアミンを使用して、本発明による方法 (a) のコースを、下のスキームによっ

50

て例示することができる。

【 0 1 1 9 】

【 化 1 8 1 】



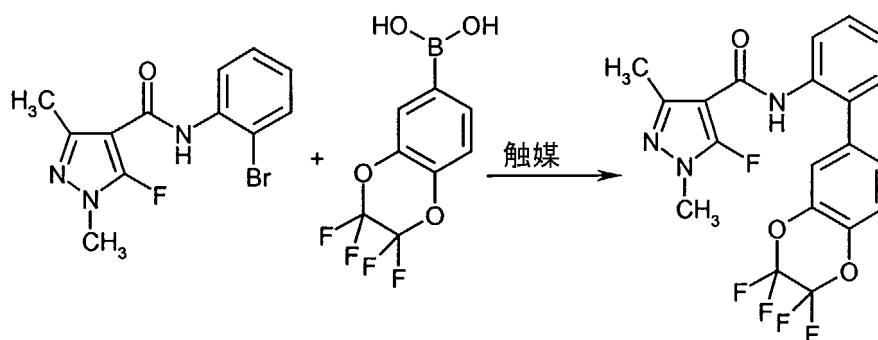
10

【 0 1 2 0 】

出発物質としてN-(2-ブロモフェニル)-5-フルオロ-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミドおよび2,2,3,3-テトラフルオロ-2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イルボロン酸を、それに触媒を使用して、本発明による方法(b)のコースを、下のスキームによって例示することができる。

【 0 1 2 1 】

【 化 1 8 2 】



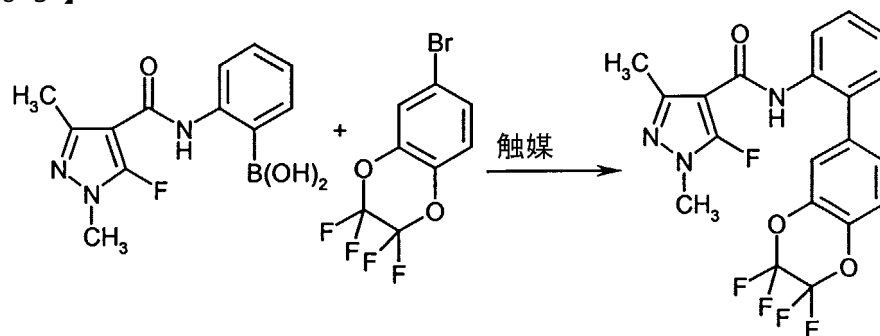
20

【 0 1 2 2 】

出発物質として2-{[(5-フルオロ-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-イル)カルボニル]アミノ}フェニルボロン酸および6-プロモ-2,2,3,3-テトラフルオロ-2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシンを、それに触媒を使用して、本発明による方法(c)のコースを、下のスキームによって例示することができる。

【 0 1 2 3 】

【 化 1 8 3 】



40

【 0 1 2 4 】

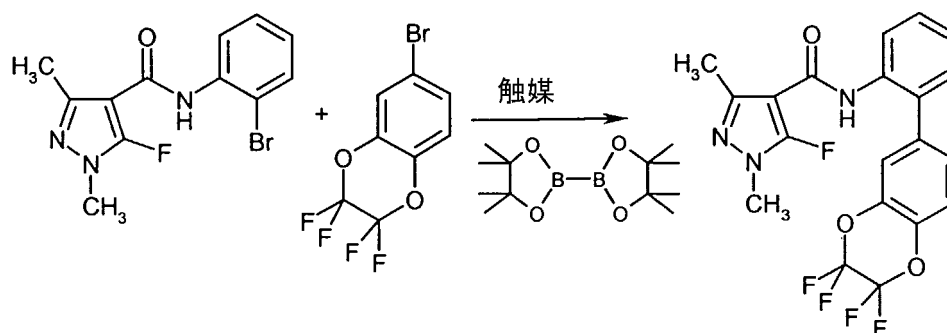
出発物質としてN-(2-ブロモフェニル)-5-フルオロ-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミドおよび6-プロモ-2,2,3,3-テトラフルオロ-2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシンを、それに触媒および4,4,4',4

50

、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使用して、本発明による方法(d)のコースを、下のスキームによって例示することができる。

【0125】

【化184】



10

【0126】

方法および中間体の説明

式(II)は、本発明による方法(a)を実施するのに出発物質として必要なカルボン酸誘導体の一般的な定義を与えている。この式では、Aは、本発明による式(I)の化合物の説明に関して、すでに、これらの基について、好ましい、特に好ましい、極めて特に好ましい、または著しく好ましいとして言及されているそれらの意味を有するのが好ましい。Gは、塩素、臭素、ヒドロキシル、メトキシ、またはエトキシを表すのが好ましく、塩素、ヒドロキシル、またはメトキシを表すのが特に好ましい。

20

【0127】

式(II)のカルボン酸誘導体は知られており、または知られている方法(WO 93/11117、EP-A 0545099、EP-A 0589301、およびEP-A 0589313を参照)により調製することができる。

【0128】

式(III)は、本発明による方法(a)を実施するのに反応成分として必要なアニリン誘導体の一般的な定義を与えている。この式では、R¹、R²、m、n、R³、およびYは、本発明による式(I)の化合物の説明に関して、すでに、これらの基またはこれらの指数について、好ましい、特に好ましい、極めて特に好ましい、または著しく好ましいとして言及されているそれらの意味を有するのが好ましい。

30

【0129】

式(III)のアニリン誘導体は新しい。その中には、知られている方法(EP-A 0545099およびEP-A 0589301を参照)により調製できるものもある。さらに、式(III)のアニリン誘導体は、

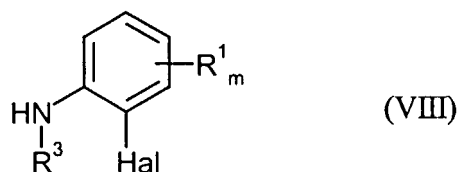
e)もし酸結合剤がある場合に適しており、もし不活性な有機希釈剤がある場合に適しており、しかももし触媒がある場合に適しているならば、

一般式(VIII)の2-ハロアニリン誘導体

40

【0130】

【化185】



(VIII)

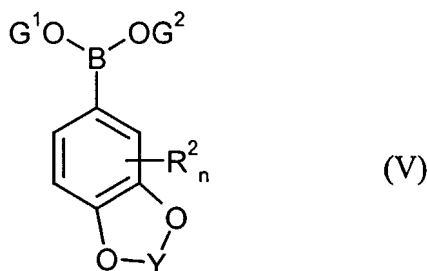
(式中、R¹、m、およびR³は上記に明示されている通りであり、Halはハロゲンを表す)を、

50

式(V)のボロン酸誘導体

【0131】

【化186】



10

(式中、 R^2 、 n 、 Y 、 G^1 、および G^2 は上記に明示されている通りである)と反応させることによって、

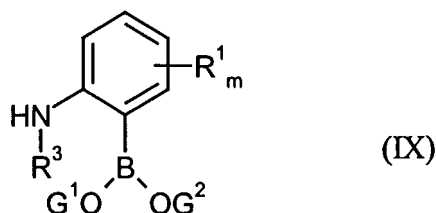
あるいは、

f)もし酸結合剤がある場合に適しており、もし不活性な有機希釈剤がある場合に適しており、しかももし触媒がある場合に適しているならば、

式(IX)のアニリンボロン酸

【0132】

【化187】



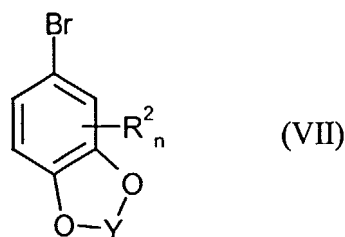
20

(式中、 R^1 、 m 、 R^3 、 G^1 、および G^2 は上記に明示されている通りである)を、

式(VII)のフェニル誘導体

【0133】

【化188】



30

(式中、 R^2 、 n 、および Y は上記に明示されている通りである)と反応させることによって得られる。

40

【0134】

式(VIII)は、本発明による方法(e)を実施するのに反応成分として必要な2-ハロアニリン誘導体の一般的な定義を与えている。この式では、 R^1 、 m 、および R^3 は、本発明による式(I)の化合物の説明に関して、すでに、これらの基またはこれらの指数について、好ましい、特に好ましい、極めて特に好ましい、または著しく好ましいとして言及されているそれらの意味を有するのが好ましい。Halは、フッ素、塩素、または臭素を表すのが好ましく、塩素、または臭素を表すのが特に好ましい。

【0135】

式(VIII)の2-ハロアニリン誘導体は知られている、および/または対応するニトロ化合物から還元により調製することができる。 R^3 が水素を表していない場合は、式

50

(V I I I)の化合物は、結果として生じるアニリン誘導体の知られている誘導体化により得ることができる。

【0136】

本発明による方法(e)を実施するのに出発物質としてさらに必要な式(V)のボロン酸誘導体は、本発明による方法(b)に関して、下の方により詳細に例示されている。

【0137】

式(IX)は、本発明による方法(f)を実施するのに反応成分として必要なアニリンボロン酸の一般的な定義を与えている。この式では、 R^1 、m、および R^3 は、本発明による式(I)の化合物の説明に関して、すでに、これらの基またはこれらの指数について、好ましい、特に好ましい、極めて特に好ましい、または著しく好ましいとして言及されているそれらの意味を有するのが好ましい。 G^1 および G^2 は、それぞれ水素を表すのが、または共にテトラメチルエチレンを表すのが好ましい。

10

【0138】

式(IX)のアニリンボロン酸は知られており、および/または知られている方法により得ることができる。

【0139】

本発明による方法(f)を実施するのに出発物質としてさらに必要な式(V I I)のフェニル誘導体は、本発明による方法(d)に関して、下の方により詳細に例示されている。

【0140】

式(IV)は、本発明による方法(b)および(d)を実施するのに出発物質として必要なカルボキサミド誘導体の一般的な定義を与えている。この式では、 R^1 、m、 R^3 、およびAは、本発明による式(I)の化合物の説明に関して、すでに、これらの基またはこれらの指数について、好ましい、特に好ましい、極めて特に好ましい、または著しく好ましいとして言及されているそれらの意味を有するのが好ましい。

20

【0141】

式(IV)のカルボキサミド誘導体は知られており、または知られている方法(例えば、WO 91/01311、EP-A 0371950を参照)により調製することができる。

【0142】

式(V)は、本発明による方法(b)および(e)を実施するのに出発物質として必要なボロン酸誘導体の一般的な定義を与えている。この式では、 R^2 、n、およびYは、本発明による式(I)の化合物の説明に関して、すでに、これらの基またはこれらの指数について、好ましい、特に好ましい、極めて特に好ましい、または著しく好ましいとして言及されているそれらの意味を有するのが好ましい。 G^1 および G^2 は、それぞれ水素を表すのが、または共にテトラメチルエチレンを表すのが好ましい。

30

【0143】

式(V)のボロン酸誘導体は知られており、および/または知られている方法(例えば、WO 01/90084およびUS 5,633,218を参照)により調製することができる。それら誘導体は、例えば、

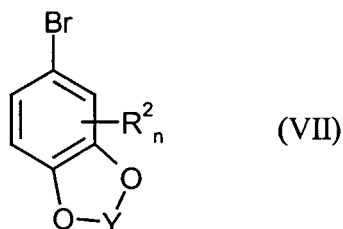
40

g) マグネシウムがある場合、もし希釈剤(例えば、テトラヒドロフラン)がある場合に適しているならば、

式(V I I)のフェニル誘導体

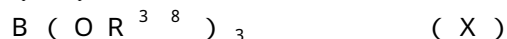
【0144】

【化 1 8 9】



(式中、 R^2 、 n 、および Y は上記に明示されている通りである)を、

式(X)のホウ酸エステル



(式中、 $R^{3\ 8}$ は $C_1 \sim C_4$ -アルキルを表す)と反応させることによって得られる。

【0 1 4 5】

式(X)は、本発明による方法(g)を実施するのに反応成分として必要なホウ酸エステルの一般的な定義を与えている。この式では、 $R^{3\ 8}$ は、メチル、エチル、 n -プロピル、または i -プロピルを表すのが好ましく、メチルまたはエチルを表すのが特に好ましい。

【0 1 4 6】

式(X)のホウ酸エステルは、合成用に知られている化学物質である。

【0 1 4 7】

式(VI)は、本発明による方法(c)を実施するのに反応成分として必要なカルボキサミドボロン酸誘導体の一般的な定義を与えている。この式では、 R^1 、 m 、 R^3 、およびAは、本発明による式(I)の化合物の説明に関して、すでに、これらの基またはこれらの指数について、好ましい、特に好ましい、極めて特に好ましい、または著しく好ましいとして言及されているそれらの意味を有するのが好ましい。 G^1 および G^2 は、それぞれ水素を表すか、または共にテトラメチルエチレンを表すのが好ましい。

【0 1 4 8】

式(VI)のカルボキサミドボロン酸誘導体は、知られており、および/または知られている方法により調製することができる。

【0 1 4 9】

式(VII)は、本発明による方法(c)、(d)、(f)、および(g)を実施するのに出発物質として必要なフェニル誘導体の一般的な定義を与えている。この式では、 R^2 、 n 、および Y は、本発明による式(I)の化合物の説明に関して、すでに、これらの基またはこれらの指数について、好ましい、特に好ましい、極めて特に好ましい、または著しく好ましいとして言及されているそれらの意味を有するのが好ましい。

【0 1 5 0】

式(VII)のフェニル誘導体は、知られており、または知られている方法(Synth. Commun. 2000、30、665-669、Synth. Commun. 1999、29、1697-1701を参照)により調製することができる。

【0 1 5 1】

本発明による方法(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、および(f)を実施するのに適した酸結合剤は、いずれの場合にも、すべての無機および有機の塩基であるのがそのような反応にとっては慣例である。水酸化ナトリウム、水酸化カルシウム、水酸化カリウム、さもないと水酸化アンモニウムのようなアルカリ土類金属またはアルカリ金属の水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸カリウム、重炭酸ナトリウムのようなアルカリ金属炭酸塩、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸カルシウムのようなアルカリ金属またはアルカリ土類金属の酢酸塩の使用が好ましく、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、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、ジアザビスシクロオクタン(DABCO)、ジアザビ

10

20

30

40

50

シクロノネン (DBN)、またはジアザビスクロウンデセン (DBU) のような第三級アミンの使用も好ましい。しかしながら、追加の酸結合剤がないときに作用することも、または、酸結合剤として同時に作用するように過剰のアミン成分を使うことも可能である。

【0152】

本発明による方法 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、および (f) を実施するのに適した希釈剤は、いずれの場合にも、すべての通常の不活性有機溶媒である。場合によっては、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、またはデカリン；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、またはトリクロロエタンのようなハロゲン化脂肪族、脂環式または芳香族の炭化水素；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル t - ブチルエーテル、メチル t - アミルエーテル、ジオキザン、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、またはアニソールのようなエーテル；アセトニトリル、プロピオニトリル、n - または i - ブチロニトリル、またはベンゾニトリルのようなニトリル；N, N - ジメチルホルムアミド、N, N - ジメチルアセタミド、N - メチルホルムアニリド、N - メチルピロリドン、またはヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド；酢酸メチル、または酢酸エチルのようなエステル；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド；または、スルホランのようなスルホンを使用するのが好ましい。

10

【0153】

本発明による方法 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、および (f) を実施するとき、いずれの場合にも、反応温度を比較的広い範囲内で変化させることができる。一般に、それらの方法を、0 ~ 140、好ましくは 10 ~ 120 で実施する。

20

【0154】

本発明による方法 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、および (f) は、一般に、どれも常圧で実施される。しかしながら、いずれの場合にも、高圧または減圧の下で操作することも可能である。

【0155】

本発明による方法 (a) を実施するとき、一般に、式 (II) の酸ハロゲン化物 1 モル当たり、1 モル、さもないと過剰の式 (III) のアニリン誘導体と 1 ~ 3 モルの酸結合剤を使用する。しかしながら、それら反応成分を他の割合で使用することも可能である。後処理を通常の方法によって行う。一般に、反応混合物に水を加え、有機相を分離して除き、乾燥後、減圧下で濃縮する。残っている残分から、もし適当ならば、クロマトグラフィーまたは再結晶のような通常の方法を使用して、依然として存在しているかもしれないどんな不純物も取り除くことが可能である。

30

【0156】

本発明による方法 (b) を実施するとき、一般に、式 (IV) のカルボキサミド 1 モル当たり、1 モル、さもないと過剰の式 (V) のボロン酸誘導体と 1 ~ 5 モルの酸結合剤を使用する。しかしながら、それら反応成分を他の割合で使用することも可能である。後処理を通常の方法によって行う。一般に、反応混合物に水を加え、そして沈澱物を分離して除いて、乾燥する。残っている残分から、もし適当ならば、クロマトグラフィーまたは再結晶のような通常の方法を使用して、依然として存在しているかもしれないどんな不純物も取り除くことが可能である。

40

【0157】

本発明による方法 (c) を実施するとき、一般に、式 (VI) のカルボキサミドボロン酸誘導体 1 モル当たり、1 モル、さもないと過剰の式 (VII) のフェニル誘導体と 1 ~ 10 モルの酸結合剤と 0.5 ~ 5 モル% の触媒を使用する。しかしながら、それら反応成分を他の割合で使用することも可能である。後処理を通常の方法によって行う。一般に、反応混合物に水を加え、そして沈澱物を分離して除いて、乾燥する。残っている残分から、もし適当ならば、クロマトグラフィーまたは再結晶のような通常の方法を使用して、依然として存在しているかもしれないどんな不純物も取り除くことが可能である。

50

【 0 1 5 8 】

本発明による方法 (d) を実施するとき、一般に、式 (I V) のカルボキサミド誘導体 1 モル当たり、1 モル、さもないと過剰の式 (V I I) のフェニル誘導体と 1 ~ 5 モルの酸結合剤と 1 ~ 5 モルの触媒を使用する。しかしながら、それら反応成分を他の割合で使用することも可能である。後処理を通常の方法によって行う。一般に、反応混合物に水を加え、そして沈澱物を分離して除いて、乾燥する。残っている残分から、もし適当ならば、クロマトグラフィーまたは再結晶のような通常の方法を使用して、依然として存在しているかもしれないどんな不純物も取り除くことが可能である。

【 0 1 5 9 】

本発明による物質は、強い殺菌剤作用を有しており、作物の保護および材料の保護において、真菌類およびバクテリアのような好ましくない微生物を抑制するのに使用することができる。

10

【 0 1 6 0 】

ネコブカビ綱、卵菌綱、ツボカビ綱、接合菌綱、子囊菌亜門、担子菌亜門、および不完全菌類を抑制するために作物の保護に防カビ剤を使うことができる。

【 0 1 6 1 】

シュードモナス科、リゾビウム科、腸内細菌科、コリネバクテリウム科、およびストリプトミセス科を抑制するために作物の保護に殺菌剤を使うことができる。

【 0 1 6 2 】

上に列挙した属名に分類される真菌による病気および細菌による病気を引き起こす病原体の中には、実施例として言及されるかもしれないが、制限するためではない。すなわち

20

例えば、*Xanthomonas campestris* pv. *oryzae* のようなザントモナス種、

例えば、*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans* のようなシュードモナス種、

例えば、エルウイニアアミロボラのようなエルウイニア種、

例えば、*Pythium ultimum* のようなクサレカビ種、

例えば、*Phytophthora infestans* のようなエキビョウキン種、

例えば、*Pseudoperonospora humuli*、または *Pseudoperonospora cubensis* のようなニセツユカビ種、

30

例えば、ブドウのべと病起因菌のようなタンジクツユカビ種、

例えば、レタスのべと病起因菌のようなラッパツユカビ種、

例えば、*Peronospora pisi*、または *P. brassicae* のようなツユカビ種、

例えば、*Erysiphe graminis* のようなウドンコカビ種、

例えば、*Sphaerotheca fuliginea* のようなスフェロテカ種、

例えば、*Podosphaera leucotricha* のようなポドスフェラ種、

例えば、*Venturia inaequalis* のようなベンチュリア種、

例えば、*Pyrenophora teres*、または *P. graminea* のような

40

ビレノフォーラ種 (分生子形 : ドレクスレラ、syn : ヘルミントスポリウム)、

例えば、*Cochliobolus sativus* のようなコクリオボラス種 (分生子形 : ドレクスレラ、syn : ヘルミントスポリウム)、

例えば、*Uromyces appendiculatus* のようなウロミセス種、

例えば、*Puccinia recondita* のようなサビキン種、

例えば、*Sclerotinia sclerotiorum* のようなスクレロチニア種、

例えば、*Tilletia caries* のようなナマグサクロボキン種、

例えば、*Ustilago nuda*、または *Ustilago avenae* のようなクロボキン種、

50

例えば、*Pellicularia sasakii*のような*Pellicularia*種、

例えば、いもち病菌のようなピリキュリア種、

例えば、*Fusarium culmorum*のようなフザリウム種、

例えば、*Botrytis cinerea*のようなボトリチス種、

例えば、*Septoria nodorum*のようなセプトリア種、

例えば、*Leptosphaeria nodorum*のようなレプトスフェリア種、

例えば、*Cercospora canescens*のようなセルコスポラ種、

例えば、*Alternaria brassicae*のようなアルターナリア種、および

例えば、*Pseudocercospora herpotrichoides*のようなシュードセルコスポレラ種。

【0163】

本発明による活性化合物は、植物を強く元気づける作用をも示す。したがって、それらの化合物は、好ましくない微生物による攻撃に対して、植物の内部防御を高めるのに適している。

【0164】

現在の状況では、植物を元気づける（抵抗誘導）化合物は、処理された植物に、続いて好ましくない微生物を接種すると、その植物がこれらの微生物に対して十分な抵抗を表すほどの植物防御システムを活気づけることができる物質を意味するものとして理解することができる。

【0165】

この場合、好ましくない微生物は、植物病原性真菌類、バクテリア、およびウイルスを意味するものとして理解することができる。したがって、本発明による化合物を、言及した病原体による攻撃に対する処理の後のある期間内に、植物を保護するために使用することができる。この保護が達成される期間は、一般に、その活性化合物で植物を処理してから、1～10日間、好ましくは1～7日間にわたる。

【0166】

その活性化合物が、植物の病気を抑制するのに必要な濃度で、植物によって十分に許容されるということにより、植物の地上部分、繁殖茎、および種の処理、および土壌の処理が可能になる。

【0167】

本発明による活性化合物は、作物の産出量を増やすのにも適している。その上、それらの化合物は、毒性が少なく、植物によって十分許容される。

【0168】

もし適当であるならば、本発明による活性化合物を、ある濃度および散布量で、植物の成長を調節するために、および有害な動物を抑制するために、除草剤としても使うことができる。もし適当であるならば、それらの化合物を、他の活性化合物を合成する場合の中間体または前駆体として使うこともできる。

【0169】

本発明によれば、すべての植物および植物のすべての部分を処理することができる。植物は、ここでは、望ましい、および望ましくない野生植物または作物植物（自然に存在する作物植物を含む）のような、すべての植物および植物群を意味すると理解することができる。作物植物は、通常の繁殖および最適化方法によって、またはバイオテクノロジーのおよび遺伝子工学の方法またはこれらの方法の組合せによって得ることができる植物であって、遺伝子移植の植物を含む植物、および植物栽培者の免許証によって保護できる、または保護できない植物栽培変種を含む植物であり得る。植物の部分は、新芽、葉、花、および根のような植物のすべての地上および地下部分と器官を意味するものと理解することができる。述べることができる例は、葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実および種であり、根、管および根茎でもある。植物の部分には、また、収穫されたもの、および成長す

る、生殖力のある繁殖材、例えば、種苗、塊茎、根茎、切り枝および種も含まれる。

【0170】

活性化化合物を用いて本発明による植物の処理および植物の部分の処理は、直接行われたり、あるいは通常の処理方法による植物の環境、生息地、または保管地域への作用によって、例えば、浸す、吹きつける、蒸発させる、噴霧化する、ばらまく、はけで塗ることによって、繁殖材の場合には、特に種の場合には、さらに1層に、または多層に被覆することによって行われる。

【0171】

材料の保護では、本発明による化合物を、好ましくない微生物による感染、および破壊に対して工業材料を保護するのに使うことができる。

10

【0172】

現在の状況における工業材料は、産業において使用するために調製された無生物材料を意味すると理解される。例えば、本発明による活性化化合物によって微生物による変化または破壊から保護されることを目的としている工業材料は、微生物により感染し、破壊される可能性のある、粘着付与剤、サイズ、紙および板、織物、革、木材、塗料およびプラスチック製品、冷却潤滑剤、および他の材料であり得る。生産工場の部分、例えば、微生物の増殖によって損なわれる可能性がある冷却水回路も、保護される材料の範囲内にあげてもよい。本発明の範囲内にあげてもよい工業材料は、粘着付与剤、サイズ、紙および板、革、木材、塗料、冷却潤滑剤、および伝熱液が好ましく、木材が特に好ましい。

【0173】

20

あげてもよい工業材料を劣化させ、または変化させることができる微生物は、例えば、バクテリア、真菌類、酵母菌、藻、および粘液生物である。本発明による活性化化合物は、真菌類、特にカビ、木材を変色させ、木材を破壊する真菌類（担子菌亜門）に対して、そして粘液生物および藻に対して作用するのが好ましい。

【0174】

次の属の微生物を例としてあげることができる。

【0175】

Alternaria tenuis のようなアルターナリア、
クロカビのようなコウジカビ、
Chaetomium globosum のようなケタマカビ、
Coniophora puetana のようなコニオフォラ、
Lentinus tigrinus のようなマツオウジシイタケ、
Penicillium glaucum のようなアオカビ、
Polyporus versicolor のようなポリポラス、
Aureobasidium pullulans のようなオーレオバシジウム、
Sclerophoma pityophila のような *Sclerophoma*、
Trichoderma viride のようなトリコデルマ、
大腸菌のようなエシェリキア、
緑膿菌のようなシュードモナス、
黄色ブドウ球菌のようなスタフィロコッカス。

30

40

【0176】

それらの特定の物理的および/または化学的特性次第では、それら活性化化合物を、溶液、乳濁液、懸濁液、粉末、泡、ペースト、顆粒、エアロゾル、および種用の高分子物質および被覆組成物のマイクロカプセル化のような通常の配合物に、およびULVの冷温フォギング配合物に変換することができる。

【0177】

これらの配合物は、知られている方法で、例えば、活性化化合物を増量剤、すなわち、液体溶媒、加圧下の液化ガス、および/または固体キャリアーと混合することによって、場合によっては、界面活性剤、すなわち、乳化剤および/または分散剤、および/または起泡剤を使用して製造される。もし使用される増量剤が水であれば、例えば、有機溶媒を補

50

助溶媒として使うことも可能である。本質的に、適当な液体溶媒は、キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレンのような芳香族化合物、クロロベンゼン、クロロエチレンまたは塩化メチレンのような塩素化芳香族化合物または塩素化脂肪族炭化水素、シクロヘキサンまたはパラフィン、例えば、石油留分のような脂肪族炭化水素、ブタノールまたはグリコールのようなアルコールおよびそのエーテルおよびエステル、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサノンのようなケトン、ジメチルフォルムアミドまたはジメチルスルホキシドのような強い極性溶媒、さもないと水である。液化ガス増量剤またはキャリアーは、標準温度および大気圧下ではガス状である液体、例えば、ハロゲン化炭化水素、さもないと、ブタン、プロパン、窒素および二酸化炭素のようなエーロゾル推進薬を意味しているものとして理解することができる。適当な固体キャリアーは、例えば、粉碎した、カオリン、粘土、タルク、白亜、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイトまたはケイ藻土のような天然鉱物、および粉碎した、微細シリカ、アルミナおよびケイ酸塩のような合成鉱物である。顆粒用の適当な固体キャリアーは、例えば、破碎して分別した、方解石、大理石、軽石、海泡石およびドロマイトのような天然岩石、さもないと、無機および有機粉末の合成顆粒、およびおが屑、ココナッツの殻、トウモロコシの穂軸およびタバコの茎のような有機材料の顆粒である。適当な乳化剤および/または起泡剤は、例えば、ポリオキシエチレンの脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンの脂肪族アルコールエーテル、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル、アルキルスルフォン酸塩、アルキル硫酸塩、アリールスルフォン酸塩、さもないと、タンパク質加水分解物のような非イオンおよび陰イオンの乳化剤である。適当な分散剤は、例えば、リグノ亜硫酸塩の廃液およびメチルセルロースである。

10

20

【0178】

カルボキシメチルセルロースのような粘着付与剤、アラビアゴム、ポリビニルアルコールおよびポリ酢酸ビニルのような、粉末、顆粒またはラテックスの形状の天然および合成のポリマー、さもないと、ケファリンおよびレシチンのような天然のリン脂質、および合成リン脂質を、配合物に使用することができる。他の可能な添加物は鉱物油および植物油である。

【0179】

無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタンおよび紺青のような着色剤、アリザリン染料、アゾ染料および金属フタロシアニン染料のような有機染料、そして鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩のような微量の栄養素を使用することも可能である。

30

【0180】

配合物は、一般的に、0.1～95重量%の活性化合物を含み、好ましくは0.5～90重量%である。

【0181】

本発明による活性化合物は、それ自体で、またはその配合物で、知られている防カビ剤、殺菌剤、ダニ駆除剤、線虫駆除剤または殺虫剤と混合して使用し、例えば、活動範囲を広げること、または抵抗の進展を防止することも可能である。多くの場合、共同的な効果が得られる。すなわち、混合物の活性は、個々の成分の活性よりも大きい。

40

【0182】

適当な混合成分は、例えば、次の化合物である。

【0183】

殺真菌剤：

2 - フェニルフェノール；硫酸 8 - ヒドロキシキノリン；

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 (andoprime)；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 (benodanil)；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 (benzamacril)；ベンザマクリル - イソブチ

50

ル；ピラナホス (b i l a n a f o s) ；ピナパクリル；ピフェニル；ピテルタノール (b i t e r t a n o l) ；プラスチックジン - S ；プロムコナゾール；ブピリメート；ブチオベート；ブチルアミン；

カルシウムポリスルフィド；カプシマイシン (c a p s i m y c i n) ；カプタフォル；カプタン；カルベンダジム；カルボキシン；カルプロパミド；カルボン；チノメチオナト (c h i n o m e t h i o n a t) ；クロベンチアゾン；クロルフェナゾール (c h l o r f e n a z o l e) ；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 (c l o z y l a c o n) ；シアゾファミド；シフルフェナミド；シモキサニル；シブロコナゾール；シブロジニル；シブロフラム；

ダガー G (D a g g e r G) ；デバカルブ (d e b a c a r b) ；ジクロフルアニド 10
；ジクロン；ジクロロフェン；ジクロシメト (d i c l o c y m e t) ；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；エボキシコナゾール；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 (f e n a p a n i l) ；フェナリモル 20
；フェンブコナゾール；フェンフラム (f e n f u r a m) ；フェンヘキサミド；フェニトロパン (f e n i t r o p a n) ；フェノキサニル；フェンピクロニル (f e n p i c l o n i l) ；フェンブロピジン；フェンブロピモルフ；フェルバム；フルアジナム；フルベンズイミン (f l u b e n z i m i n e) ；フルジオキサニル；フルメトベル (f l u m e t o v e r) ；フルモルフ (f l u m o r p h) ；フルオロミド (f l u o r o m i d e) ；フルオキサストロビン (f l u o x a s t r o b i n) ；フルキンコナゾール；フルルブリミドール；フルシラゾール；フルスルファミド；フルトラニル；フルトリアフォル；フォルベット；フォセチル - A 1 ；フォセチル - 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 (30
アルベシル) ；ヨードカルブ (i o d o c a r b) ；イブコナゾール；イプロベンフォス；イブロジオン；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 (i s o v a l e d i o n e) ；

カスガマイシン；クレソキシム - メチル；

マンコゼブ；マネブ；メフェリムゾン；メパニピリム；メプロニル；メタラクシル；メ 40
タラクシル - M ；メトコナゾール；メタスルホカルブ；メトフロキサム (m e t h f u r o x a m) ；メチラム；メトミノストロビン；メトスルホバックス (m e t s u l p h o v a x) ；ミルジオマイシン；ミクロブタニル；ミクロゾリン；

ナタマイシン；ニコピフェン (n i c o b i f e n) ；ニトロタル (n i t r o t h a l) - イソプロピル；ノピフルムロン；ヌアリモル (n u a r i m o l) ；

オフレース (o f u r a c e) ；オリサストロビン；オキサジキシル；オキシリン酸； 40
オクスボコナゾール；オキシカルボキシン；オキシフェンチン (o x y f e n t h i i n) ；

バクロブトラゾール；ペフラゾエート；ベンコナゾール；ベンシクロン；ホスジフェン (p h o s d i p h e n) ；フタリド；ピコキシストロビン；ピペラリン (p i p e r a l i n) ；ポリオキシン；ポリオキシリム；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；プロパノシン (p r o p a n o s i n e) - ナトリウム；プロピコナゾール；プロピネブ；プロキナジド (p r o q u i n a z i d) ；プロチオコナゾール (p r o t h i o c o n a z o l e) ；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 (p y r o x y f u r) ；ピロレニトリン (p y r r o l e n i t r i n e) ；

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（teclofotalam）；テクナゼン；テトシクラシス（tetcyclacis）；テトラコナゾール；チアベンダゾール；チシオフエン（thicyofen）；チフルザミド；チオフアネート・メチル；チラム；チオキシミド（tioxyimid）；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；トリアジメノール；トリアズブチル；トリアゾキシド；トリシクラミド；トリシクラゾール；トリデモルフ；トリフロキシストロピン；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；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；

10

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；

メチル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-カルボキシレート；炭酸一カリウム；

20

N-（6-メトキシ-3-ピリジニル）-シクロプロパンカルボキサミド；

N-ブチル-8-（1,1-ジメチルエチル）-1-オキサスピロ[4.5]デカン-3-アミン；

テトラチオ炭酸ナトリウム；

ボルドー混合物などの銅塩および製剤；水酸化銅；ナフテン酸銅；オキシ塩化銅；硫酸銅；クフラネブ；酸化銅；マンコッパー（mancopper）；オキシ銅。

【0184】

殺菌剤：

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、硫酸銅およびその他の銅製剤。

30

【0185】

殺虫剤／殺ダニ剤／殺線虫剤：

アバメクチン、ABG-9008、アセフェート、アセキノシル、アセタミプリド、アセトブロール、アクリナトリン、AKD-1022、AKD-3059、AKD-3088、アラニカルブ、アルジカルブ、アルドキシカルブ、アレスリン、アレスリン1R-異性体、-シベルメトリン（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、AZ-60541、アザジラクチン、アザメチホス、アジンホス・メチル、アジンホス・エチル、アゾシクロチン、

40

乳化病菌、バチルススファエリカス（*Bacillus sphaericus*）、枯草菌、バチルスチューリングゲンシス（*Bacillus thuringiensis*）、バチルスチューリングゲンシス株EG-2348、バチルスチューリングゲンシス株GC-91、バチルスチューリングゲンシス株NCTC-11821、バキュロウイルス、ボーバリアバシアナ（*Beauveria bassiana*）、ボーバリアテネラ（*Beauveria tenella*）、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ベンサルタブ（*ben sul tap*）、ベンゾキシメート、-シフルトリン、-シベルメトリン、ピフェナゼート、ピフェントリン、ピナパクリル、バイオアレトリン、バイオアレトリン-S-シクロペンチル-異性体、バイオエタノメトリン（*bioethanomethrin*）、バイオペルメトリン（*biopermethrin*）、バイオレスメトリン、ピストリ

50

フルロン、BPMC、ブロフェンブロックス (brofenprox)、ブromoホス - エチル、ブromoブロピレート、ブromフェンビンホス (bromfeninfos) (-メチル)、BTG-504、BTG-505、ブフェンカルブ (bufencarb)、ブプロフェジン、ブタチオフォス (butathiofos)、プトカルボキシム、プトキシカルボキシム、プチル - ピリダベン、

カズサフォス、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、CGA-50439、チノメチオナット、クロルダン、クロルジメホルム、クロエトカルブ、クロルエトキシフォス、クロルフェナピル、クロルフェンビンフォス、クロルフルアズロン、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、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 - レスメトリン、シス - ベルメトリン、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)、コドルモン (codlemone)、クマフォス、シアノフェンホス、シアノホス、シクロブレン (cycloprene)、シクロプロトリン、コドリナ (Cydia pomonella)、シフルトリン、シハロトリン、シヘキサチン、シペルメトリン、シフェノトリン (1R - トランス - 異性体)、シロマジン、

DDT、デルタメトリン、デメトン - S - メチル、デメトン - S - メチルスルホン、ジアフェンチウロン、ジアリホス、ジアジノン、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 (docusat) - ナトリウム、ドフェナピン (dofenapyn)、DOWCO-439、

エフルシラネート (eflusilanate)、エマメクチン、エマメクチン - ベンゾエート、エンペントリン (1R - 異性体)、エンドスルファン、Entomopthora spp.、EPN、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、エトフェンブロックス、エトキサゾール、エトリムホス、

ファミフル、フェナミホス、フェナザキン、フェンブタチンオキシド (fenbutatin oxide)、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 (fenoxacrim)、フェノキシカルブ、フェンプロパトリン、フェンピラド、フェンピリトリン、フェンピロキシメート、フェンスルホチオン、フェンチオン、フェントリファニル (fentriphanil)、フェンバレレート、フィプロニル、フロニカミド、フルアクリピリム、フルアズロン、フルベンジミン、フルプロシトリネート (flubrocycythrinate)、フルシクロクスロン (flucycloxuron)、フルシトリネート、フルフェネリム、フルフェノクスロン、フルフェンブロックス、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))、フルバリネート、フォノフォス、ホルメタネート、ホルモチオン、ホスメチラン (fosmethilan)、ホスチアゼート、フブフェンブロックス (fubfenprox) (フルプロキシフェン)、フラチオカルブ、

- HCH、ゴシブルーレ (gossypure)、グランドルーレ (grandlure)、顆粒症ウイルス、

ハルフェンブロックス、ハロフェノジド (halofenozide)、HCH、HCN-801、ヘブテノホス、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾックス、ヒドラメチルノン、ヒドロブレン、

IKA-2002、イミダクロプリド、イミプロトリン、インドキサカルブ、ヨードフェンフォス、イプロベンフォス、イサゾフォス、イソフェンフォス、イソプロカルブ、イソキサチオン、イベルメクチン、

ジャボニルーレ (japonilure)、カデトリン、核多核体病ウイルス、キノブレン、

10

20

30

40

50

- シハロトリン、リンダン、ルフェヌロン、

マラチオン、メカルバム、メスルフェンホス、メトアルデヒド、メタム - ナトリウム、
メタクリホス、メタミドホス、*Metharhizium anisopliae*、*Metharhizium flavoviride*、メチダチオン、メチオカルブ、メトミ
ル、メトブレン、メトキシクロル、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、MKI - 245、MON - 4570
0、モノクロトホス、モキシデクチン、MTI - 800、

ナレド、NC - 104、NC - 170、NC - 184、NC - 194、NC - 196、
ニコロサミド、ニコチン、ニテンピラム、ニチアジン、NNI - 0001、NNI - 01
01、NNI - 0250、NNI - 9768、ノバルロン、ノビフルムロン、

OK - 5101、OK - 5201、OK - 9601、OK - 9602、OK - 9701
、OK - 9802、オメソエート (omethoate)、オキサミル、オキシデメトン
- メチル、

Paecilomyces fumosoroseus、パラチオン - メチル、パラチ
オン (- エチル)、ペルメトリン (シス - 、トランス -)、石油、PH - 6045、フェ
ノトリン (1R - トランス異性体)、フェントエート、フォレート、ホサロン、ホスメッ
ト、ホスファミドン、ホスホカルブ (phosphocarb)、ホキシム、ピペロニル
ブトキシド、ピリミカルブ、ピリミホス - メチル、ピリミホス - エチル、プラレトリン、
プロフェノホス、プロメカルブ、プロパホス、プロパルギト、プロベタムホス、プロボク
スル、プロチオホス、プロトエート、プロトリフェンブテ (protrifenbute
)、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、

キナルホス、レスメトリン、RH - 5849、リバピリン、RU - 12457、RU -
15525、S - 421、S - 1833、サリチオン、セブホス (sebufos)、S
I - 0009、シラフルオフエン、スピノサッド、スピロジクロフェン、スピロメシフェ
ン、スルフルラミド、スルホテップ、スルプロホス、SZI - 121、

タウ - フルバリネート、テブフェノジド、テブフェンピラド、テブピリムホス (teb
upirimfos)、テフルベンズロン、テフルトリン、テメホス、テミピンホス、タ
ーバム、テルブホス、テトラクロルピンホス、テトラジホン、テトラメトリン、テトラメ
トリン (1R - 異性体)、テトラスル、 - シベルメトリン、チアクロプリド、チアメト
キサム、チアプロニル (thiapronil)、チアトリホス (thiatriphos)、シュウ酸水素チオシクラム、チオジカルブ、チオファノックス、チオメトン、チオ
スルタップ (thiosultap) - ナトリウム、スリンジエンシン (thuring
iensin)、トルフェンピラド、トラロシスリン (tralocythrin)、ト
ラロメトリン、トランス - フルスリン、トリアラテン (triaarathene)、トリ
アザメート、トリアゾホス、トリアズロン (triazuron)、トリクロフェニジン
(trichlorophenidine)、トリクロルホン、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 (vaniliprole)、ベルブチン (verbu
tin)、*Verticillium lecanii*、

WL - 108477、WL - 40027、YI - 5201、YI - 5301、YI - 5
302、XMC、キシリルカルブ、

XA - 3274、 - シベルメトリン、ゾラプロホス (zolaprofos)、ZX
I - 8901、

化合物 3 - メチルフェニルプロピルカルバメート (ツマシド 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 登録番号 1
85982 - 80 - 3) および対応する 3 - エンド - 異性体 (CAS 登録番号 18598
4 - 60 - 5) (WO - 96 / 37494、WO - 98 / 25923)、

10

20

30

40

50

ならびに殺虫活性な植物抽出物、線虫、真菌またはウイルスを含む製剤。

【0186】

除草剤のような他の知られている活性化合物との、または肥料および成長調節剤、毒性緩和剤および/または信号物質との混合物も可能である。

【0187】

その上、本発明による式(I)の化合物は、また、非常によい抗カビ活性を有している。それらの化合物は、特に皮膚糸状菌および酵母菌、カビおよび両相性真菌類(例えば、*Candida albicans*、*Candida glabrata*のようなカンジダ種に対して)、および*Epidermophyton floccosum*、クロカビおよび*Aspergillus fumigatus*のようなコウジカビ種、*Trichophyton mentagrophytes*のようなハクセンキン種、*Microsporon canis*および*audouinii*のような*Microsporon*種に対して非常に広い抗カビ活性範囲を有している。これらの真菌類のリストは、包含することができる真菌性スペクトラムを決して制限するものではなく、例証のためだけである。

10

【0188】

それらの活性化合物は、それ自体で、それらの配合物の形状で、またはすぐ使える溶液、懸濁液、水和剤、ペースト、可溶性粉末、粉末および顆粒のようなそれから調製した使用形態で使うことができる。使用は、通常の方法で、例えば、散水する、吹き付ける、霧化する、散布する、振りかける、泡立てる、分散させる等によって行われる。さらに、活性化合物を超低容量の方法によって施用すること、または活性化合物の調製をまたは活性化合物そのものを土壤中に注入することが可能である。植物の種を処理することも可能である。

20

【0189】

本発明による活性化合物を防カビ剤として使用するとき、その散布量は、用途の種類により、比較的広い範囲内で変化させることができる。植物の部分を処理する場合、活性化合物の散布量は、一般に、0.1~10,000g/ヘクタール、好ましくは10~1,000g/ヘクタールである。種子粉衣の場合、活性化合物の散布量は、一般に、種1kg当たり0.001~50g、好ましくは種1kg当たり0.01~10gである。土壌を処理する場合、活性化合物の散布量は、一般に、0.1~10,000g/ヘクタール、好ましくは1~5,000g/ヘクタールである。

30

【0190】

すでに上で述べたように、本発明によりすべての植物およびそのすべての部分を処理することができる。好ましい実施形態では、野生植物種および植物の栽培変種、または異種交配または原形質融合のような通常の生物学的繁殖によって得られる植物種、およびその部分が処理される。さらに好ましい実施形態では、もし従来の方法との組み合わせに適しているならば(遺伝的に変化した生物)、遺伝子工学によって得られる遺伝子導入植物および植物栽培変種およびその部分を処理する。用語の「部分」、または「植物の部分」、または「植物部分」は上で説明されている。

【0191】

特に好ましいのは、いずれの場合にも市販されている、または使用されている植物栽培変種の植物を本発明により処理することである。植物栽培変種は、新しい性質(「習性」)を有しており、しかも通常の繁殖によって、突然変異誘発によって、または組み替えDNA技術によって得られた植物を意味するものと理解することができる。それらの植物は、栽培変種、変種、生物型、または遺伝子型であり得る。

40

【0192】

植物種または植物栽培変種、その場所および生育条件(土壌、気候、植物期間、肥料)によっては、本発明による処理は付加的(「相乗」)効果も併せてもたらす可能性がある。したがって、例えば、本発明により使用することができる物質および組成物の少ない散布量および/または活動範囲の拡張および/または活性の増加、より良い植物の生長、高

50

温または低温への耐性が増すこと、干ばつに対する、または水もしくは土壌の塩分含有量に対する耐性が増すこと、開花能力が増すこと、収穫が容易であること、成熟が促進されること、高い収穫高、収穫した産物の品質が良いことおよび/または栄養価が高いこと、収穫した産物の貯蔵安定性が良いことおよび/または加工性が良いことを、実際に期待した効果を超えて達成することが可能である。

【0193】

本発明により処理されるのが好ましい遺伝子移植の植物または植物栽培変種（すなわち、遺伝子工学によって得られるもの）には、遺伝子組み替えにおいて、特に有利な役立つ性質（「習性」）をこれらの植物に与える遺伝物質を受け取ったすべての植物が含まれる。そのような性質の例は、より良い植物の生長、高温または低温への耐性が増すこと、干ばつに対する、または水もしくは土壌の塩分含有量に対する耐性が増すこと、開花能力が増すこと、収穫が容易であること、成熟が促進されること、高い収穫高、収穫した産物の品質が良いことおよび/または栄養価が高いこと、収穫した産物の貯蔵安定性が良いことおよび/または加工性が良いことである。さらに、そして特に強調されるそのような性質の例は、昆虫、ダニ、植物病原性真菌類、バクテリアおよび/またはウイルスに対するような、有害な動物および有害な微生物に対するより良い防御であり、ある種の除草活性の化合物に対する植物の耐性が増すことでもある。挙げることができる遺伝子移植植物の例は、穀物（小麦、米）、トウモロコシ、大豆、ジャガイモ、綿、タバコ、脂肪種子のような重要な作物植物であり、果実植物（リンゴ、西洋ナシ、柑橘類の果実、およびブドウの果実をつけている）でもあり、特にトウモロコシ、大豆、ジャガイモ、綿、タバコおよび脂肪種子の菜種が注目されている。注目される習性は、特に、植物中に生成される毒素、特にパチルスチューリングゲンシスからの遺伝物質によって（例えば、遺伝子CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3BbおよびCryIFに、およびその組合せにもよって）植物中に生成される毒素によって昆虫に対する植物の防御を増すことである（本明細書では以下、「Bt植物」と呼ぶ）。同様に特に注目される習性は、全身獲得耐性（SAR）、システムイン、植物性アレキシン、誘導因子、耐性遺伝子、および相応して表されるタンパク質および毒素によって、真菌類、バクテリア、およびウイルスに対する植物の防御が増すことである。さらに、特に注目される習性は、ある種の除草活性の化合物、例えば、イミダゾリノン、スルホニル尿素、グリホサート、またはホスフィノトリシン（例えば、「PAT」遺伝子）に対する植物の耐性が増すことである。問題の望ましい習性を与える遺伝子は、遺伝子移植植物に互いに一緒に存在することでもある。挙げることができる「Bt植物」の例は、YIELD GARD（登録商標）（例えば、トウモロコシ、綿、大豆）、Knock Out（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Star Link（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Bollgard（登録商標）（綿）、Nucotton（登録商標）（綿）、およびNew Leaf（登録商標）（ジャガイモ）の商標名で販売されているトウモロコシの変種、綿の変種、大豆の変種、およびジャガイモの変種である。挙げることができる除草剤に耐性がある植物の例は、Roundup Ready（登録商標）（グリホサートに耐性がある、例えば、トウモロコシ、綿、大豆）、Liberty Link（登録商標）（ホスフィノトリシンに耐性がある、例えば、脂肪種子の菜種）、IMI（登録商標）（イミダゾリノンに耐性がある）、およびSTS（登録商標）（スルホニル尿素に耐性がある、例えば、トウモロコシ）の商標名で販売されているトウモロコシの変種、綿の変種、および大豆の変種である。挙げることができる耐除草剤植物（除草剤耐性のために通常の方法で繁殖された植物）には、Clearfield（登録商標）（例えば、トウモロコシ）の名前で販売されている変種もある。もちろん、これらの記述は、これらの遺伝形質、またはこれからも開発されることになる遺伝形質を有している植物栽培変種にも、および将来開発および/または販売される植物栽培変種にも応用される。

【0194】

列挙した植物を、一般式（I）の化合物を使い、または本発明による活性化合物の混合

物を使って特に有利な方法で本発明により処理することができる。その活性化合物または混合物について上で述べた好ましい範囲は、これらの植物の処理にも施用される。本明細書で明確に述べた化合物または混合物を使って植物を処理することが特に注目される。

【0195】

本発明による活性化合物の調製および使用を、下記の実施例によって例示する。

【0196】

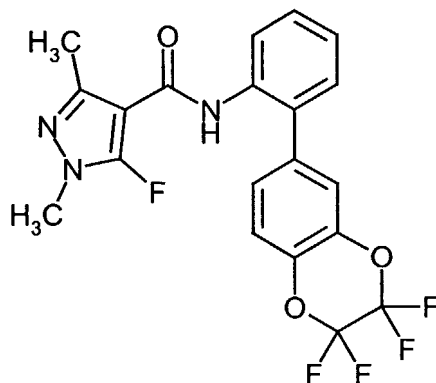
調製実施例

(実施例1)

【0197】

【化190】

10



20

【0198】

10 ml の n - ブタノール中 3 . 12 g の N - (2 - ブロモフェニル) - 5 - フルオロ - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドと 3 . 28 g の 2 , 2 , 3 , 3 - テトラフルオロ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イルボロン酸 (V - 1) の溶液に、9 . 77 g の炭酸セシウムと 2 ml の水を加える。攪拌し、大気圧のアルゴンの下で、60 mg のテトラキス - (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) を加える。その反応混合物を、80 で、8 時間攪拌する。後処理用に、その混合物を水の中に注ぎ、酢酸エチルで抽出し、抽出物を乾燥して濃縮する。その残分をシリカゲルによりクロマトグラフィーで分離する (シクロヘキサン / 酢酸エチルが 2 : 1) 。

30

【0199】

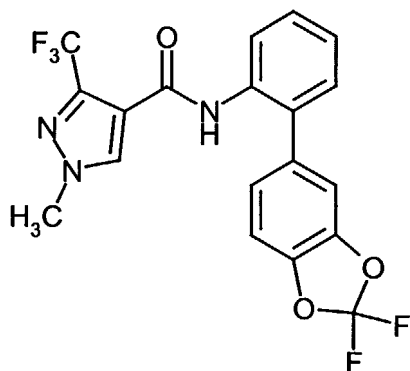
こうして、4 . 00 g (理論の 83 %) の 5 - フルオロ - 1 , 3 - ジメチル - N - [2 - (2 , 2 , 3 , 3 - テトラフルオロ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イル) フェニル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドが無色の固体の形 [10 g P (pH 2 . 3) = 3 . 77] で得られる。

【0200】

(実施例2)

【0201】

【化 1 9 1】



10

【0202】

アルゴンの下で、0.37 g (1.6ミリモル)の5-ブromo-2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジオキソール、0.4 g (1.6ミリモル)の4,4,4',4',5,5',5'-オクタメチル-2,2'-ビス-1,3,2-ジオキサボロラン、および0.42 g (4.3ミリモル)の酢酸カリウムを、5 mlのジメチルスルホキシドに懸濁させて、0.05 g (0.07ミリモル)の1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセンパラジウム(II)塩化物を加える。80 で2時間後に、その混合物を室温まで冷却し、0.51 g (1.3ミリモル)のN-(2-ヨードフェニル)-1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド(IV-1)、3.25 mlの炭酸ナトリウムの2モル溶液、さらに0.05 g (0.07ミリモル)の1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセンパラジウム(II)塩化物を加える。70 で45分後に、その混合物を5 mlの水で希釈して、毎回50 mlの酢酸エチルで3回抽出する。抽出物を、硫酸ナトリウムの上で乾燥し、ろ過して減圧下で濃縮する。その粗生成物をジエチルエーテルに取り入れ、シリカゲルによりクロマトグラフィーで分離する(シクロヘキサン/酢酸エチルが3:1)。

20

【0203】

こうして、0.23 g (理論の41%)のN-[2-(2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)-フェニル]-1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド[log P (pH 2.3) = 3.37]が得られる。

30

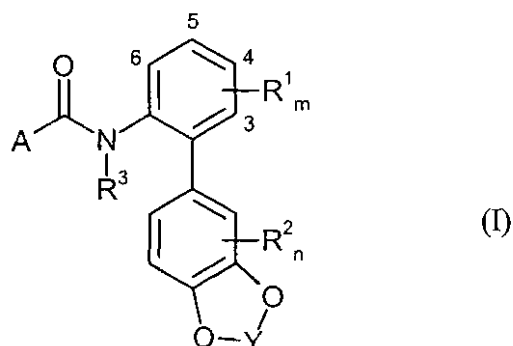
【0204】

下記の表1に記載した式(I)のビフェニルカルボキサミドは、さらに上記の実施例1および2と同じように、そしてその方法の一般的な記述に従って調製される。

【0205】

【表1】

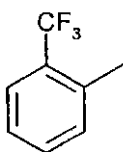
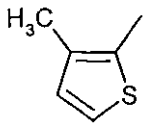
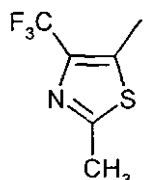
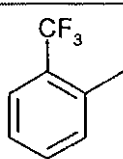
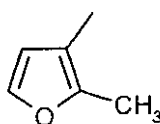
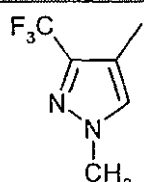
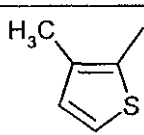
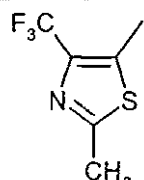
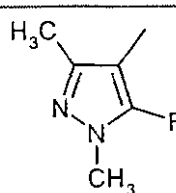
表1



(I)

40

50

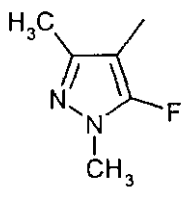
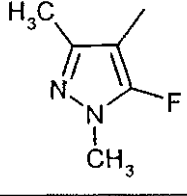
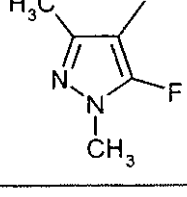
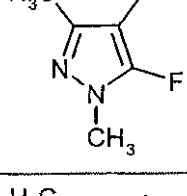
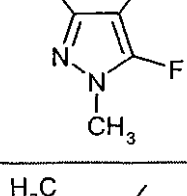
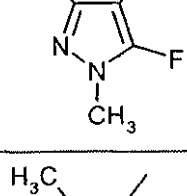
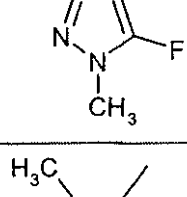
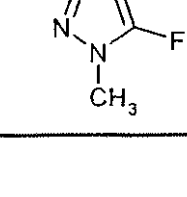
実施例 番号	R^1_m	R^2_n	R^3	Y	A	logP (pH2.3)
3	H	H	H	-CF ₂ -		3.94
4	H	H	H	-CF ₂ -		3.99
5	H	H	H	-CF ₂ -		3.81
6	H	H	H	-(CF ₂) ₂ -		5.93
7	H	H	H	-(CF ₂) ₂ -		4.08
8	H	H	H	-(CF ₂) ₂ -		3.85
9	H	H	H	-(CF ₂) ₂ -		4.46
10	H	H	H	-(CF ₂) ₂ -		3.94
11	4,5-F ₂	H	H	-CH ₂ -		3.24

10

20

30

40

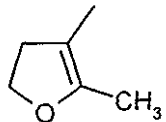
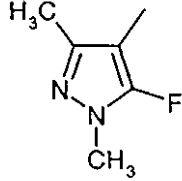
実施例 番号	R^1_m	R^2_u	R^3	Y	A	logP (pH2.3)
12	4-Cl	H	H	-CH ₂ -		3.32
13	4-CH ₃ , 5-F	H	H	-CH ₂ -		3.37
14	5-CH ₃	H	H	-CH ₂ -		3.01
15	4,6-F ₂	H	H	-CH ₂ -		2.34
16	4-CH ₃	H	H	-CH ₂ -		3.10
17	4-F, 6-Cl	H	H	-CH ₂ -		2.53
18	4-Cl, 6-F	H	H	-CH ₂ -		2.74
19	H	H	H	-CF ₂ -		3.22

10

20

30

40

実施例 番号	R ¹ _m	R ² _n	R ³	Y	A	logP (pH2.3)
20	H	H	H	-CH ₂ -		2.87
21	H	H	Me	-(CF ₂) ₂ -		3.44

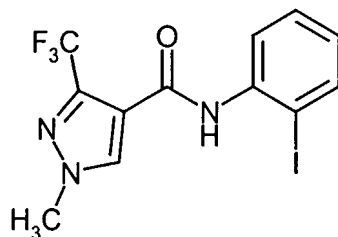
10

【 0 2 0 6 】

式 (I V) の出発物質の調製
(実施例 (I V - 1))

【 0 2 0 7 】

【 化 1 9 2 】



20

【 0 2 0 8 】

6.57 g (30.0 ミリモル) の 2 - ヨードアニリン、および 6.1 g (60.0 ミリモル) の トリエチルアミンを 100 ml の テトラヒドロフランに溶解し、室温で 7.65 g (36.0 ミリモル) の 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - 塩化カルボニルをゆっくり加える。その反応溶液を 50 で 16 時間加熱する。後処理用に、その混合物を減圧下で濃縮し、その粗生成物をシリカゲルによりクロマトグラフィーで分離する (シクロヘキサン / 酢酸エチルが 1 : 1) 。

30

【 0 2 0 9 】

こうして、10.0 g (理論の 85 %) の N - (2 - ヨードフェニル) - 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド [log P (pH 2.3) = 2.46] が得られる。

【 0 2 1 0 】

式 (V) の出発物質の調製
(実施例 (V - 1))

40

【 0 2 1 1 】

Oc1ccc2c(c1)oc(c2)C(F)(F)F

10

20 ml のテトラヒドロフラン（無水）中 4.86 g のマグネシウム削り屑の懸濁液に、わずかのヨウ素粒子を加え、次いで、60 ml のテトラヒドロフラン中 57.4 g の 6 - ブロモ - 2, 2, 3, 3 - テトラフルオロ - 2, 3 - ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾジオキシンを、アルゴン雰囲気の下で滴状に加える。滴状添加の速度を調節することにより、その発熱反応を沸騰点近くに維持する。滴状添加が終わったら、その混合物を還流させながら 30 分間攪拌し、次いで室温に冷却する。そのグリニャール試薬の溶液を、60 ml のテトラフラン中 29.2 g のホウ酸トリエチル溶液と一緒に、-10 で 30 分間にわたり、100 ml のテトラヒドロフランに滴状に加える。それから、その混合物を -10 でもう 1 時間攪拌し、次いで室温に温めて、もう 30 分攪拌する。後処理用に、その反応溶液を、-10 で、14 ml の水で加水分解し、80 ml の 10 % 濃度の硫酸を用いて pH 4 に調節する。その混合物をジエチルエーテルで抽出して、水相を塩化ナトリウムで飽和させ、ジエチルエーテルで抽出する。そのエーテル相と一緒にしたもの、200 ml の水と共に、濃縮する。その固体残分を少しの塩化メチレンと共に粉碎し、吸引ろ過して除き、乾燥する。

20

【 0 2 1 2 】

こうして、47.3 g (理論の75%)の2,2,3,3-テトラフルオロ-2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル-ボロン酸[log P (pH 2.3) = 2.49]が得られる。

【 0 2 1 3 】

調製実施例に示すlog P値は、EEC Directive 79/831 Annex V. A8に従って、逆相カラム(C18)を用いてHPLC(高性能液体クロマトグラフィー)によって測定された。温度は43℃。

30

【 0 2 1 4 】

酸性範囲の測定のための移動相：0.1%リン酸水、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形勾配。

【 0 2 1 5 】

校正は、知られている $\log P$ 値（2つの連続したアルカノン間の線形補間を使う保持時間による $\log P$ 値の測定）を有する分枝していないアルカン - 2 - オン（3 ~ 16の炭素原子を有する）を使って行われた。

40

【 0 2 1 6 】

ラムダの最大値を、200 nm ~ 400 nmの紫外線スペクトルを使ってクロマトグラフ信号の最大値で測定した。

【 0 2 1 7 】

使用の実施例

(实施例 A)

ポドスフェラ試験（リンゴ）／保護物

溶媒： 24.5重量部のアセトン、24.5重量部のジメチルアセタミド

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

活性化合物の適切な調製を実現するために、1重量部の活性化合物を、記載した量の溶

50

媒および乳化剤と混合し、その濃縮物を水で所要の濃度まで希釈する。

【0218】

保護活性について試験するために、活性化合物の調製品を若い植物に記載した散布量で吹き付ける。その吹き付け被覆物が乾いたら、その植物に、リンゴのうどん粉病の病原体である *Podospheera leucotricha* の水性孢子懸濁液を接種する。次いで、その植物を約23 および約70%の相対大気湿度の温室に入れる。

【0219】

接種の10日後に評価を行う。0%は対照の効果に相当する効果を意味するのに対して、100%の効果は感染がまったく観察されないことを意味する。

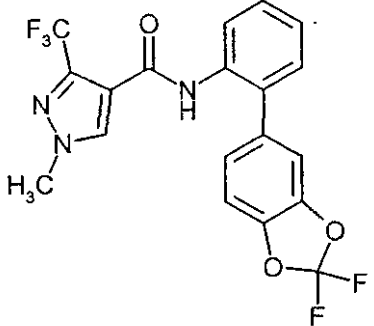
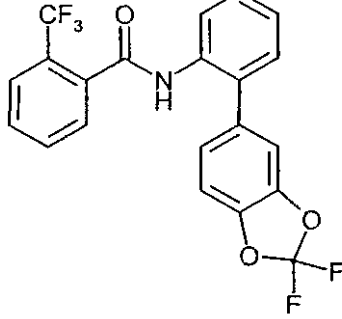
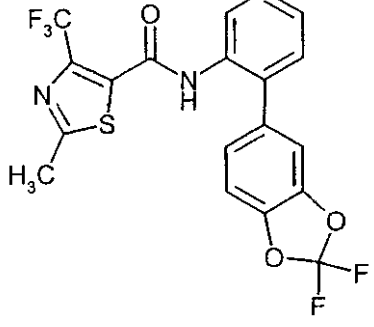
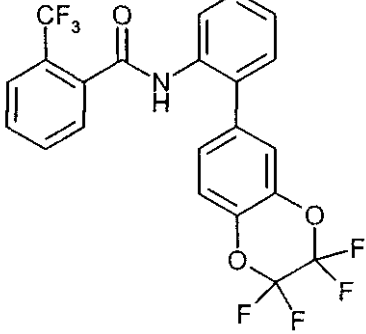
【0220】

活性化合物、散布量、および試験結果を下記の表に示す。

【0221】

【表 2】

表A
ポドスフェラ試験（リンゴ）／保護物

	活性化合物	g／ヘクタールで 表した 活性化合物 の散布量	%で表した効果
2		100	100
3		100	100
5		100	100
6		100	100

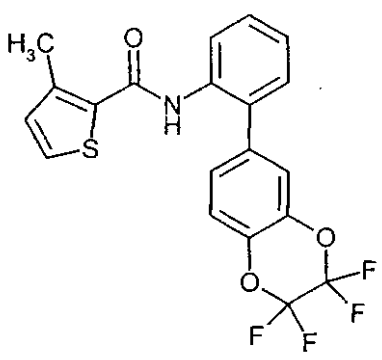
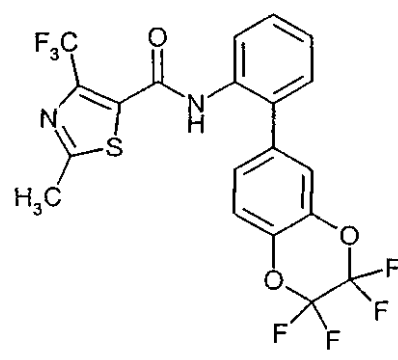
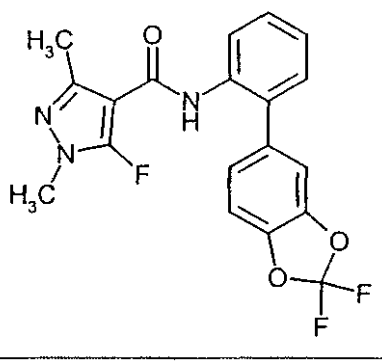
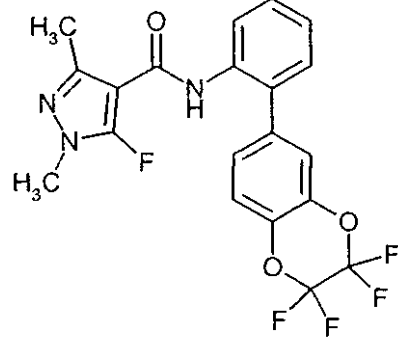
10

20

30

40

表A
ポドスフェラ試験（リンゴ）／保護物

	活性化化合物	g／ヘクタールで 表した活性化化合物 の散布量	%で表した効果
9		100	100
10		100	100
19		100	100
1		100	100

10

20

30

40

【 0 2 2 2 】

(実施例 B)

スフェロテカ試験（キュウリ）／保護物

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タミド

50

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

活性化合物の適切な調製を実現するために、１重量部の活性化合物を、記載した量の溶媒および乳化剤と混合し、その濃縮物を水で所要の濃度まで希釈する。

【０２２３】

保護活性について試験するために、活性化合物の調製品を若い植物に記載した散布量で吹き付ける。その吹き付け被覆物が乾いたら、その植物に、*Sphaerotheca fuliginea*の水性孢子懸濁液を接種する。次いで、その植物を約２３ および約７０％の相対大気湿度の温室に入れる。

【０２２４】

接種の７日後に評価を行う。０％は対照の効果に相当する効果を意味するのに対して、10
１００％の効果は感染がまったく観察されないことを意味する。

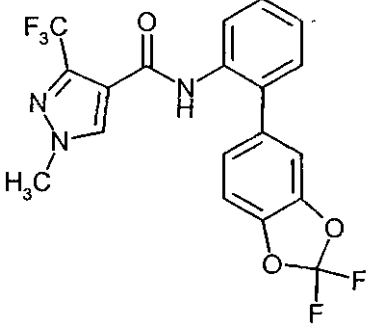
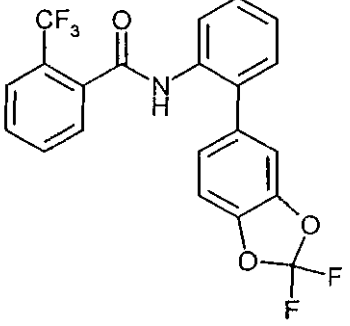
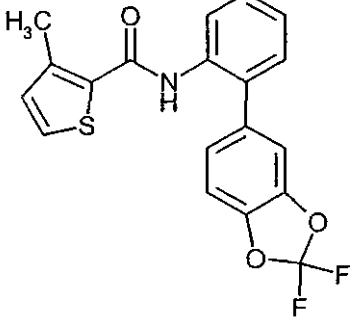
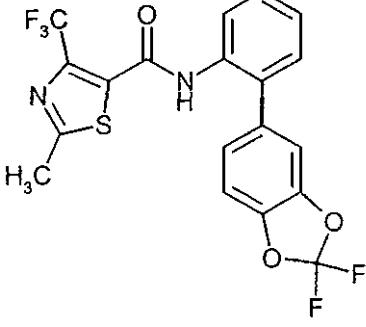
【０２２５】

活性化合物、散布量、および試験結果を下記の表に示す。

【０２２６】

【表 3】

表B
スフェロテカ試験（キュウリ）／保護物

	活性化合物	g／ヘクタールで 表した活性化合物 の散布量	%で表した効果
2		100	100
3		100	98
4		100	100
5		100	100

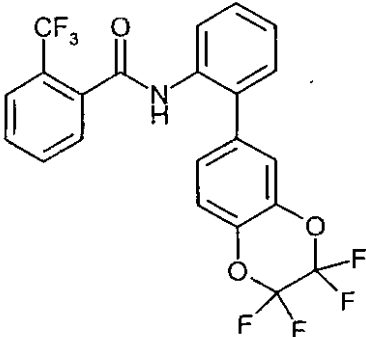
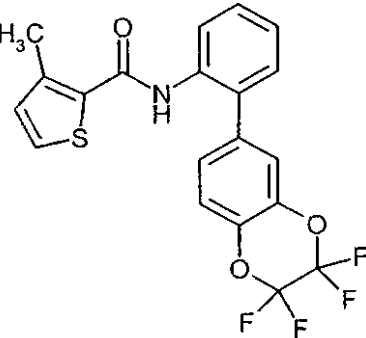
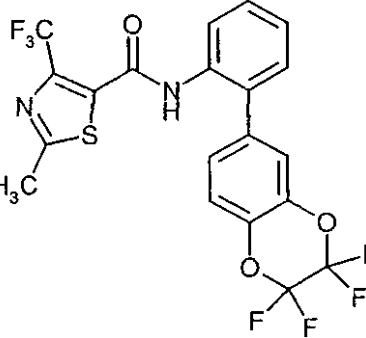
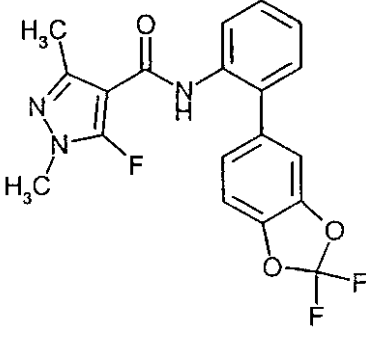
10

20

30

40

表B
スフェロテカ試験（キュウリ）／保護物

	活性化合物	g／ヘクタールで 表した活性化合物 の散布量	%で表した効果
6		100	100
9		100	100
10		100	100
19		100	92

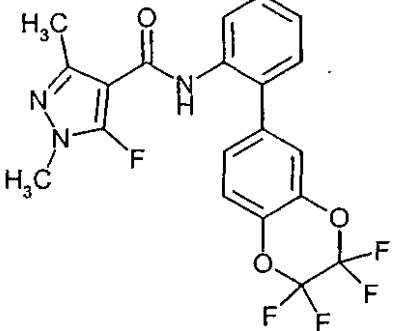
10

20

30

40

表B
スフェロテカ試験（キュウリ）／保護物

	活性化合物	g／ヘクタールで 表した活性化合物 の散布量	%で表した効果
1		100	98

10

【0227】

20

(実施例C)

ベンチュリア試験（リンゴ）／保護物

溶媒： 24.5重量部のアセトン、24.5重量部のジメチルアセタミド

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

活性化合物の適切な調製を実現するために、1重量部の活性化合物を、記載した量の溶媒および乳化剤と混合し、その濃縮物を水で所要の濃度まで希釈する。

【0228】

保護活性について試験するために、活性化合物の調製品を若い植物に記載した散布量で吹き付ける。その吹き付け被覆物が乾いたら、その植物に、リンゴの腐敗病の病原体である *Venturia inaequalis* の水性分生子懸濁液を接種し、次いで、約20で100%の相対大気湿度の培養室に1日間そのままにしておく。

30

【0229】

それから、その植物を、約21および約90%の相対大気湿度の温室に入れる。

【0230】

接種の10日後に評価を行う。0%は対照の効果に相当する効果を意味するのに対して、100%の効果は感染がまったく観察されないことを意味する。

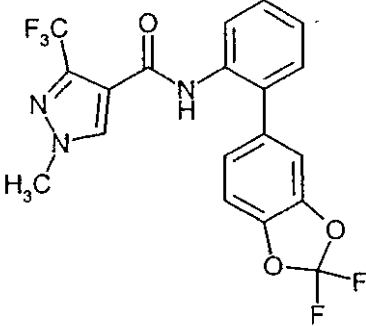
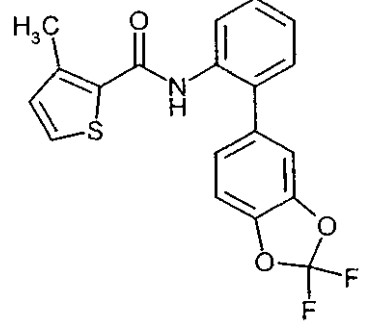
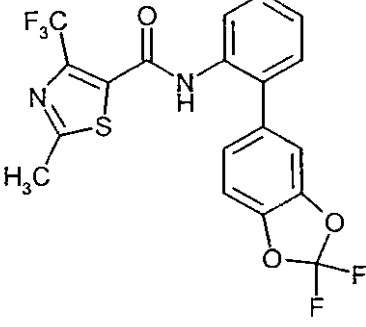
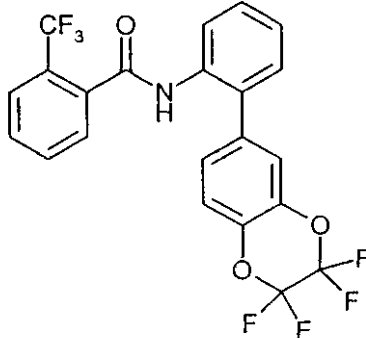
【0231】

活性化合物、散布量、および試験結果を下記の表に示す。

【0232】

【表 4】

表 C
ベンチュリア試験（リンゴ）／保護物

	活性化化合物	g／ヘクタールで 表した活性化化合物 の散布量	%で表した効果
2		100	100
4		100	98
5		100	100
6		100	99

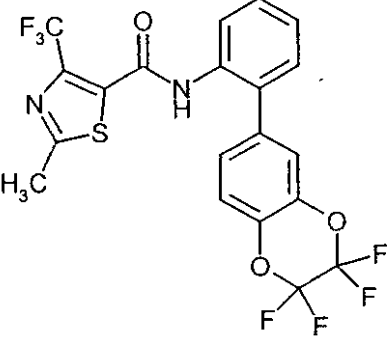
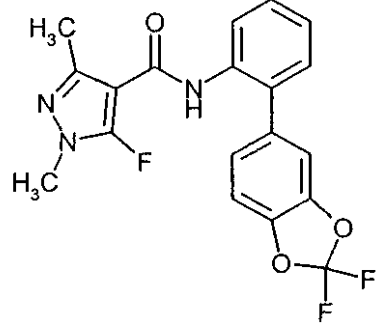
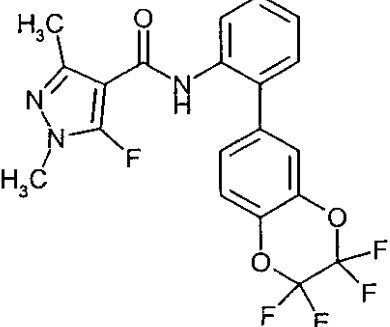
10

20

30

40

表C
ベンチュリア試験（リンゴ）／保護物

	活性化化合物	g／ヘクタールで 表した活性化化合物 の散布量	%で表した効果
10		100	100
19		100	96
1		100	100

10

20

30

【0233】

(実施例D)

アルターナリア試験（トマト）／保護物

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

活性化化合物の適切な調製を実現するために、1重量部の活性化化合物を、記載した量の溶媒および乳化剤と混合し、その濃縮物を水で所要の濃度まで希釈する。

【0234】

保護活性について試験するために、活性化化合物の調製品を若いトマトの木に記載した散布量で吹き付ける。その処理の1日後に、その木に、*Alternaria solani*の孢子懸濁液を接種し、次いで、100%の相対湿度および20℃で24時間そのままにしておく。それから、その木を96%の相対大気湿度および20℃の温度にそのままにしておく。

40

50

【 0 2 3 5 】

接種の7日後に評価を行う。0 %は対照の効果に相当する効果を意味するのに対して、100 %の効果は感染がまったく観察されないことを意味する。

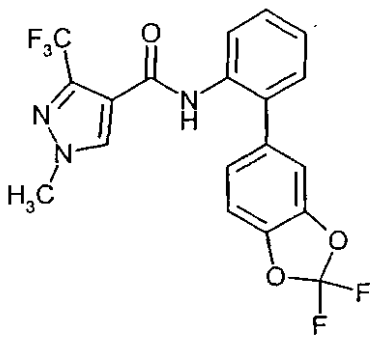
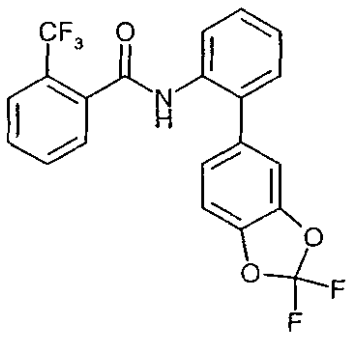
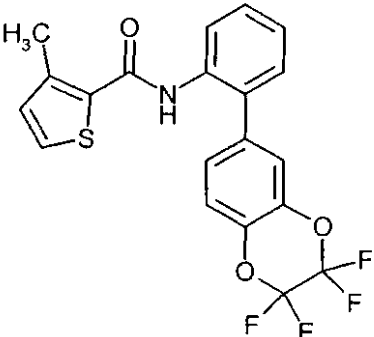
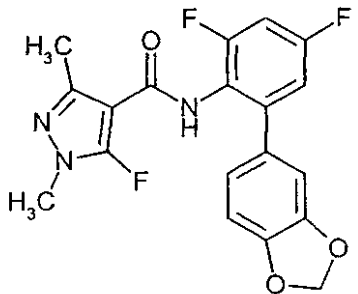
【 0 2 3 6 】

活性化化合物、散布量、および試験結果を下記の表に示す。

【 0 2 3 7 】

【表 5】

表 D
アルタナーリア試験（トマト）／保護物

	活性化合物	g／ヘクタールで 表した活性化合物 の散布量	%で表した効果
2		750	100
3		750	94
9		750	95
15		750	95

10

20

30

40

【 0 2 3 8 】

(実施例 E)

サビキン試験（小麦）／保護物

溶媒： 25重量部のN，N - ジメチルアセタミド

乳化剤： 0.6重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

50

活性化合物の適切な調製を実現するために、1重量部の活性化合物を、記載した量の溶媒および乳化剤と混合し、その濃縮物を水で所要の濃度まで希釈する。

【0239】

保護活性について試験するために、活性化合物の調製品を若い植物に記載した散布量で吹き付ける。その吹き付け被覆物が乾いたら、その植物に、*Puccinia recondita*の分生子懸濁液を吹き付ける。その植物を、20 および100%の相対大気湿度の培養室に48時間そのままにしておく。

【0240】

それから、その植物を、約20 の温度および80%の相対大気湿度の温室に入れて、さび菌のいばの発生を促す。

【0241】

接種の10日後に評価を行う。0%は対照の効果に相当する効果を意味するのに対して、100%の効果は感染がまったく観察されないことを意味する。

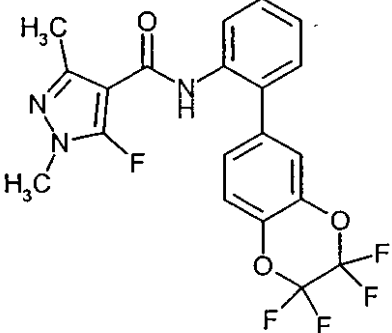
【0242】

活性化合物、散布量、および試験結果を下記の表に示す。

【0243】

【表6】

表E
サビキン試験（小麦）／保護物

	活性化合物	g／ヘクタールで表した活性化合物の散布量	%で表した効果
1		500	100

【0244】

（実施例F）

担子菌亜門の大きなコロニーを使つての抑制試験

菌糸体種を、担子菌亜門種の*Coriolus versicolor*の大きなコロニーから追い出し、麦芽エキスのペプトンを含む普通寒天培地の上26 で培養する。培養液を含んだ活性化合物の上での菌糸の成長の抑制を、添加された活性化合物のない培養液による長期的成長と比較し、パーセントの抑制として評価した。

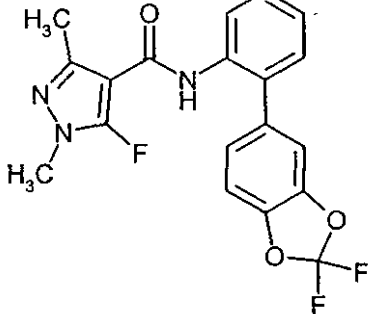
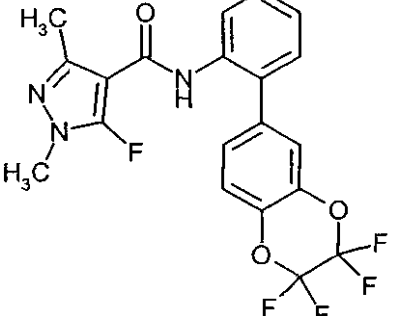
【0245】

この試験では、例えば、調製実施例の本発明による次の化合物が良好な活性を示す。

【0246】

【表 7】

表 F
担子菌亜門の大きなコロニーを使つての抑制試験

	活性化合物	ppmで表した 活性化合物の 散布量	%で表した効果
19		6	100
1		6	100

10

20

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International Application No. PCT/EP 03/03964
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 7 C07C233/77 C07D319/16 C07D317/46 A01N43/30		
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 C07C C07D		
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, BEILSTEIN Data, PAJ, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 5 633 218 A (SPEDDING DONNA L ET AL) 27 May 1997 (1997-05-27) Tabelle 10, T=0, W=Einfachbindung R2=Me, R1=Phenyl; Beispiel 3, Schritte A und B; Spalte 39, Zeilen 4-16; Spalte 35, Zeile 46 - Spalte 36, Zeile 53	1-11
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of box C. <input checked="" type="checkbox"/> 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 21 August 2003		Date of mailing of the international search report 01/09/2003
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 Kleidermigg, O

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 03/03964

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 5633218	A	27-05-1997	NONE

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP 03/03964

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES		
IPK 7 C07C233/77 C07D319/16 C07D317/46 A01N43/30		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE		
Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)		
IPK 7 C07C C07D		
Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff 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, BEILSTEIN Data, PAJ, CHEM ABS Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	US 5 633 218 A (SPEDDING DONNA L ET AL) 27. Mai 1997 (1997-05-27) Tabelle 10, T=0, W=Einfachbindung R2=Me, R1=Phenyl; Beispiel 3, Schritte A und B; Spalte 39, Zeilen 4-16; Spalte 35, Zeile 46 - Spalte 36, Zeile 53 -----	1-11
<input type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen <input checked="" type="checkbox"/> 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 Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt worden 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 erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden *Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer 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 nahelegend ist *Z* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche		Absandatedatum des internationalen Recherchenberichts
21. August 2003		01/09/2003
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 Kleidernigg, O

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 03/03964

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 5633218	A	27-05-1997	KEINE

フロントページの続き

(51)Int.Cl. ⁷	F I	テーマコード(参考)
C 0 7 D 405/12	C 0 7 D 405/12	
C 0 7 D 407/12	C 0 7 D 407/12	
C 0 7 D 409/12	C 0 7 D 409/12	
C 0 7 D 417/12	C 0 7 D 417/12	
// C 0 7 B 61/00	C 0 7 B 61/00	3 0 0

(81)指定国 AP(GH,GM,KE,LS,MW,MZ,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,PT,RO,SE,SI,SK,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA, GN,GQ,GW,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BR,BY,BZ,CA,CH,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DZ, EC,EE,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,MA,MD,MG,MK,MN,M W,MX,MZ,NI,NO,NZ,OM,PH,PL,PT,RO,RU,SC,SD,SE,SG,SK,SL,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,YU,ZA,ZM,ZW

- (72)発明者 デウンケル,ラルフ
ドイツ国、4 0 7 8 9・モンハイム、クリシエルシュトラッセ・2 2
- (72)発明者 エルベ,ハンス-ルートビヒ
ドイツ国、4 2 3 2 9・ブツパータール、ダスネツケル・5 9
- (72)発明者 リーク,ハイコー
フランス国、エフ-6 9 0 0 9・リヨン、リュ・ピエール・ベイズ・1 4・2 0
- (72)発明者 マルケルト,ロベルト
ドイツ国、5 1 0 6 5・ケルン、シレジウスシュトラッセ・8 2
- (72)発明者 バツヘンドルフ-ノイマン,ウルリーケ
ドイツ国、5 6 5 6 6・ノイビート、オーバー・マルケンベーク・8 5
- (72)発明者 マオラー-マハニク,アストリット
ドイツ国、4 2 7 9 9・ライヒリンゲン、ノイエンカムパー・ベーク・4 8
- (72)発明者 クツク,カール-ハインツ
ドイツ国、4 0 7 6 4・ランゲンフェルト、パストア-レー-シュトラッセ・3 0・アー
- (72)発明者 クグラー,マルティーン
ドイツ国、4 2 7 9 9・ライヒリンゲン、アム・クロスター・4 7
- (72)発明者 ヤエチユ,トーマス
ドイツ国、5 0 6 7 0・ケルン、インネレ・カナルシュトラッセ・2 2 0

Fターム(参考) 4C063 AA01 BB09 CC81 CC82 CC92 DD22 DD62 DD73 DD75 DD82
EE03
4H011 AA01 BA01 BA05 BB08 BB09 BB10 BC05 BC06 BC19 DA16
DC05 DH03
4H039 CA41 CA42 CD20 CD90