

CASTELLANOS & CO.
A B O G A D O S
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

212

Señora

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Desarrollo Económico

E.

S.

D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-051478- -00008-0000

Fecha: 2009-04-21 15:21:51 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eve. 379 FASENACIONALII
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 30

Ref.: Expediente No. 05.051.478

Solicitud de Patente de Invención para: **QUINOLIN-, ISOQUINOLIN- Y QUINAZOLIN-
OXIALQUILAMIDAS Y SU USO COMO FUNGICIDAS**

Solicitante: **SYNGENTA LIMITED**

RESPUESTA AL EXAMEN DE FONDO

MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO, mayor de edad, identificada y domiciliada como aparece al pié de mi firma, atentamente me permito presentar respuesta al oficio No. 0704 notificado por fijación en lista el 23 de enero de 2009 correspondiente al examen de fondo, estando dentro del término legal en los siguientes términos:

Presento copia del siguiente documento requerido por su Despacho con el fin de llevar a cabo el examen de fondo de la solicitud de la referencia:

- **Patent Abstracts of Japan. Vol 2000, no 21, 3 august 2001 (2001-08-03) & JP 2001 089453 A (KUMIAI CHEM IND CO LTD, IHARA CHEM IND CO LTD), 3 April 2001 (2001-04-03)**

Adicionalmente, presento la traducción a inglés de la primera página y las reivindicaciones del documento JP2001 089453.

De la Señora Jefe,


Margarita Castellanos Abondano

C.C. No. **39.779.654** de Usaquén

T.P.A. No. **70819** del C. Sup. de la Judicatura

Calle 94 A No. 7 A - 09

Teléfonos: 610 74 20

Bogotá, D.C.,

21 ABR. 2009

213
213

C07D277/74

C07D285/08

C07D285/13

(21)Application number : 11-266612 (71)Applicant : KUMIAI CHEM IND CO LTD
IHARA CHEM IND CO LTD

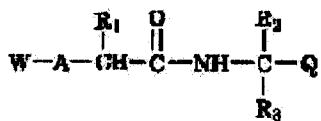
(22)Date of filing : 21.09.1999 (72)Inventor : MASUDA KATSUMI
URUSHIBATA IKUMI
MATSUMOTO
KATSUNORI
YONEKURA NORIHISA
FURUSE KATSUMI
TOYOSHIMA ATSUSHI
KUMAKURA KAZUO
MURAMATSU
NORIMICHI

**(54) HETEROARYLOXY(THIO)ALKANOIC ACID AMIDE DERIVATIVE
AND GERMICIDE FOR AGRICULTURE AND HORTICULTURE**

(57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a new germicide having high controlling effect on plant disease injuries, especially rice blast, etc., without having bad influence on crops.

SOLUTION: This heteroaryloxy(thio)alkanoic acid amide derivative is represented by the general formula [1] [W is a heteroaryl group which may be substituted by X_n; A is oxygen atom or the like; R₁ is hydrogen atom or the like; R₂ is 1-6C alkyl group or the like; R₃ is a 2-6C alkyl group or the like; Q is ethynyl group; R₄ is a 1-6C alkyl group or the like; X is 1-6C alkyl group or the like; n is an integer of 0-4]. This germicide for agriculture and horticulture contains the above acid amide derivative as an active ingredient.



[1]

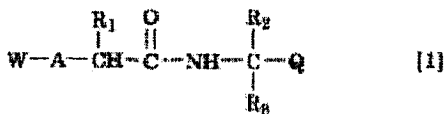
214 2/4

HETEROARYLOXY(THIO)ALKANOIC ACID AMIDE DERIVATIVE AND GERMICIDE FOR AGRICULTURE AND HORTICULTURE**Publication number:** JP2001089453 (A)**Publication date:** 2001-04-03**Inventor(s):** MASUDA KATSUMI; URUSHIBATA IKUMI; MATSUMOTO KATSUNORI; YONEKURA NORIHISA; FURUSE KATSUMI; TOYOSHIMA ATSUSHI; KUMAKURA KAZUO; MURAMATSU NORIMICHI**Applicant(s):** KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO; IHARA CHEMICAL IND CO**Classification:**

- International: C07D249/12; A01N43/42; A01N43/52; A01N43/54; A01N43/56; A01N43/58; A01N43/60; A01N43/653; A01N43/66; A01N43/76; A01N43/78; A01N43/824; A01N43/836; C07D215/22; C07D231/20; C07D235/26; C07D237/32; C07D239/34; C07D239/46; C07D241/18; C07D241/44; C07D251/30; C07D263/58; C07D277/20; C07D277/34; C07D277/36; C07D277/68; C07D277/74; C07D285/08; C07D285/13; C07D277/34; C07D249/00; A01N43/34; A01N43/48; A01N43/64; A01N43/72; C07D215/00; C07D231/00; C07D235/00; C07D237/00; C07D239/00; C07D241/00; C07D251/00; C07D263/00; C07D277/00; C07D285/00; C07D277/00; (IPC1-7): C07D215/22; A01N43/42; C07D231/20; C07D235/26; C07D237/32; C07D239/34; C07D241/18; C07D249/12; C07D251/30; C07D263/58; C07D277/34; C07D285/08

- European:**Application number:** JP19990266612 19990921**Priority number(s):** JP19990266612 19990921**Abstract of JP 2001089453 (A)**

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a new germicide having high controlling effect on plant disease injuries, especially rice blast, etc., without having bad influence on crops. **SOLUTION:** This heteroaryloxy(thio)alkanoic acid amide derivative is represented by the general formula [1] [W is a heteroaryl group which may be substituted by X_n; A is oxygen atom or the like; R₁ is hydrogen atom or the like; R₂ is 1-6C alkyl group or the like; R₃ is a 2-6C alkyl group or the like; Q is ethynyl group; R₄ is a 1-6C alkyl group or the like; X is 1-6C alkyl group or the like; n is an integer of 0-4]. This germicide for agriculture and horticulture contains the above acid amide derivative as an active ingredient.



Data supplied from the esp@cenet database — Worldwide

215
215

(19) Japan Patent Office (JP)

(12) Published Patent Application (A)

(11) Publication Number: Japan Unexamined Patent Publication 2001-89453(P2001-89453A)

(43) Date of Publication of Application: April 3 (2001. 4.3), Heisei 13

(54) Title of the Invention: A heteroaryloxy (thio) alkanolic acid amide derivative and germicide for agriculture and horticulture

Request for Examination: Un-requested

Number of Claims: 5

OL

Number of Pages in the Document: 23

(21) Application Number: Japan Patent Application Heisei 11-266612

(22) Date of Filing: September 21 (1999. 9.21), Heisei 11

(71) Applicant(s): KUMIAI CHEM IND CO LTD

(71) Applicant(s): IHARA CHEM IND CO LTD

(72) Inventor(s): MASUDA KATSUMI

(72) Inventor(s): URUSHIBATA IKUMI

(72) Inventor(s): MATSUMOTO KATSUNORI

(72) Inventor(s): YONEKURA NORIHISA

(72) Inventor(s): FURUSE KATSUMI

(72) Inventor(s): TOYOSHIMA ATSUSHI

(72) Inventor(s): KUMAKURA KAZUO

(72) Inventor(s): MURAMATSU NORIMICHI

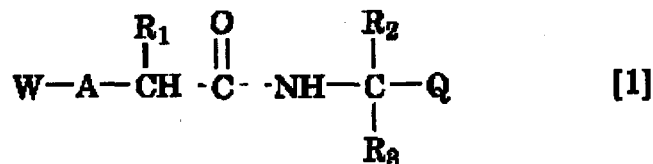
(57) [Abstract]

[Subject]

It is to obtain a new germicide which has a high controlling effect on plant disease, especially rice blast, etc., without having a bad influence on crops.

[Settlement means]

The heteroaryloxy (thio) alkanolic acid amide derivative represented by the general formula [1], and the germicide for agriculture and horticulture containing the above as an active ingredient.



[In the formula]

W represents a hetero aryl group which may be substituted by X_n, a represents an oxygen atom etc., R₁ represents a hydrogen atom etc., R₂ represents C₁ - C₆ alkyl group, etc., R₃ represents C₂ - C₆ alkyl group, etc., Q represents an ethynyl group etc., R₄ represents C₁ - C₆ alkyl group, etc., X represents C₁ - C₆ alkyl group, etc., and n represents an integer of 0-4.]

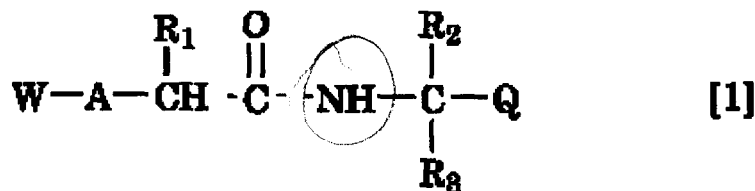
216
26

[Claims]

[Claim 1]

The (thio) alkane acid amide derivative represented by the general formula [1].

[Chemical formula 1]



[In the formula, W represents a hetero aryl group which may be substituted by X_n,

A represents an oxygen atom or a sulfur atom,

R₁ represents a hydrogen atom, C₁ - C₆ alkyl group or C₃ - C₆ cycloalkyl group,

R₂ represents C₁ - C₆ alkyl group or C₃ - C₆ cycloalkyl group,

R₃ represents C₂ - C₆ alkyl group, C₃ - C₆ cycloalkyl group (this group may be substituted by a halogen atom or C₁ - C₆ alkyl group.), C₃ - C₆ cycloalkyl C₁ - C₆ alkyl group or C₁ - C₄ haloalkyl group,

or R₂ and R₃ are combined to each other and form a 5-membered to 7-membered ring cycloalkyl group (this group may be substituted by C₁ - C₆ alkyl group.) with the carbon atom which each of these are combined,

Q represents an ethynyl group, a cyano group, and a group-COR₄ or a group-CH(OH) R₄,

R₄ represents C₁ - C₆ alkyl group, C₁ - C₄ haloalkyl group, or C₃ - C₆ cycloalkyl group (this group may be substituted by a halogen atom or C₁ - C₆ alkyl group.),

X represents C₁ - C₆ alkyl group, C₂ - C₆ alkenyl group, C₂ - C₆ alkynyl group, C₃ - C₆ cycloalkyl group, C₁ - C₄ haloalkyl group, C₁ - C₆ alkoxy group, C₂ - C₆ alkenyl oxy group, C₂ - C₆ alkynyl oxy group, C₃ - C₆ cycloalkyl oxy group, C₁ - C₄ haloalkoxy group, C₁ - C₆ alkyl thio group, C₂ - C₆ alkenyl thio group, C₂ - C₆ alkynyl thio group, C₃ - C₆ cyclo alkyl thio group, C₁ - C₄ haloalkyl thio group, a halogen atom, a phenyl group (this group may be substituted by C₁ - C₆ alkyl group, C₁ - C₄ haloalkyl group, C₁ - C₆ alkoxy group, a cyano group, or a halogen atom.), a cyano group or a nitro group, and n represents an integer of 0-4.]

[Claim 2]

The compound given in Claim 1 wherein each W is a pyrazolyl group which may be substituted by X_n, a triazolyl group, an oxazolyl group, an isooxazolyl group, a thiazolyl group, an isothiazolyl group, an oxadiazolyl group, a thiadiazolyl group, a pyrazinyl group, a pyridazinyl group, an indolyl group, an indazolyl group, a benzothiazolyl group, a benzo oxazolyl group, a benzimidazolyl group, an isoquinolyl group, a cinnolinyl group, a phthalazinyl group, a quinoxalinyl group, or a naphthyridinyl group, and Q is a cyano group

[Claim 3]

The compound given in Claim 1 wherein each W is a pyrazolyl group which may be substituted by X_n, triazolyl group, an oxazolyl group, an isooxazolyl group, a thiazolyl group, an isothiazolyl group, an oxadiazolyl group, a thiadiazolyl group, a 2-pyrimidinyl group, a pyrazinyl group, a pyridazinyl group, a triazinyl group, an indolyl group, an indazolyl group, a benzothiazolyl group, a benzo oxazolyl group, a benzimidazolyl group, a quinolyl group, an

217
2/17

isoquinolyl group, a cinnolinyl group, a phthalazinyl group, a quinoxalinyl group, or a naphthyridinyl group, and Q is an ethynyl group and a group-COR₄ or a group-CH(OH)R₄.

[Claim 4]

The compound given in Claim 1 wherein each W is a pyrazolyl group which may be substituted by X_n, triazolyl group, a thiadiazolyl group, a 2-pyrimidinyl group, a pyrazinyl group, a pyridazinyl group, a triazinyl group, a benzothiazolyl group, a benzo oxazolyl group, a benzimidazolyl group, a quinolyl group, a phthalazinyl group, or a quinoxalinyl group, and Q is an ethynyl group and a group-COR₄ or a group-CH(OH)R₄.

[Claim 5]

The germicide for agriculture and horticulture which contains the (thio) alkane acid amide derivative given in Claim 1 to 4 as an active substance.

218
218

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開2001-89453

(P2001-89453A)

(43) 公開日 平成13年4月3日 (2001.4.3)

(51) Int.Cl. ⁷	識別記号	F I	テマート* (参考)
C 0 7 D 215/22		C 0 7 D 215/22	4 C 0 3 1
A 0 1 N 43/42	1 0 1	A 0 1 N 43/42	1 0 1 4 C 0 3 3
43/52		43/52	4 C 0 3 6
43/54		43/54	C 4 C 0 6 6
43/56		43/56	C 4 H 0 1 1

審査請求 未請求 請求項の数5 O L (全 23 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願平11-266612

(22) 出願日 平成11年9月21日 (1999.9.21)

(71) 出願人 000000169

クミアイ化学工業株式会社

東京都台東区池之端1丁目4番26号

(71) 出願人 000102049

イハラケミカル工業株式会社

東京都台東区池之端1丁目4番26号

(72) 発明者 増田 勝美

静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1

株式会社ケイ・アイ研究所内

(72) 発明者 漆畑 育巳

静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1

株式会社ケイ・アイ研究所内

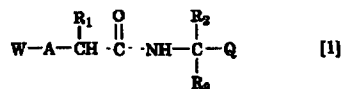
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 ヘテロアリールオキシ (チオ) アルカン酸アミド誘導体及び農園芸用殺菌剤

(57) 【要約】

【課題】作物に悪影響を及ぼすことなく、植物病害、特にイネいもち病等に対し高い防除効果を有する新規殺菌剤を提供する。

【解決手段】一般式 [1]

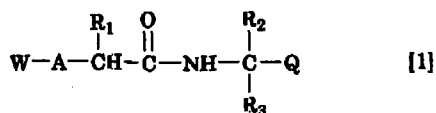


【式中、WはXnによって置換されてもよいヘテロアリール基を表し、Aは酸素原子等を表し、R₁は水素原子等を表し、R₂はC₁~C₆アルキル基等を表し、R₃は、C₂~C₆アルキル基等を表し、Qはエチニル基等を表し、R₄はC₁~C₆アルキル基等を表し、XはC₁~C₆アルキル基等を表し、nは0~4の整数を表す。】にて示されるヘテロアリールオキシ(チオ)アルカン酸アミド誘導体及びこれらを有効成分とする農園芸用殺菌剤。

【特許請求の範囲】

【請求項1】一般式[1]

【化1】



〔式中、WはXnによって置換されてもよいヘテロアリアル基を表し、Aは酸素原子又は硫黄原子を表し、R₁は水素原子、C₁~C₆アルキル基又はC₃~C₆シクロアルキル基を表し、R₂は、C₁~C₆アルキル基又はC₃~C₆シクロアルキル基を表し、R₃は、C₂~C₆アルキル基、C₃~C₆シクロアルキル基(該基はハロゲン原子又はC₁~C₆アルキル基によって置換されていてもよい)、C₃~C₆シクロアルキルC₁~C₆アルキル基又はC₁~C₄ハロアルキル基を表すか、あるいはR₂とR₃は互いに結合してこれらが結合している炭素原子と共に5員~7員環のシクロアルキル基(該基はC₁~C₆アルキル基によって置換されていてもよい。)を形成し、Qはエチニル基、シアノ基、基-COR₄又は基-CH(OH) R₄を表し、R₄はC₁~C₆アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基又はC₃~C₆シクロアルキル基(該基はハロゲン原子又はC₁~C₆アルキル基によって置換されていてもよい。)を表し、XはC₁~C₆アルキル基、C₂~C₆アルケニル基、C₂~C₆アルキニル基、C₃~C₆シクロアルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₆アルコキシ基、C₂~C₆アルケニルオキシ基、C₂~C₆アルキニルオキシ基、C₃~C₆シクロアルキルオキシ基、C₁~C₄ハロアルコキシ基、C₁~C₆アルキルチオ基、C₂~C₆アルケニルチオ基、C₂~C₆アルキニルチオ基、C₃~C₆シクロアルキルチオ基、C₁~C₄ハロアルキルチオ基、ハロゲン原子、フェニル基(該基はC₁~C₆アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₆アルコキシ基、シアノ基又はハロゲン原子によって置換されていてもよい)、シアノ基又はニトロ基を表し、nは0~4の整数を表す。〕にて示されるヘテロアリアルオキシ(チオ)アルカン酸アミド誘導体。

【請求項2】WがそれぞれXnによって置換されてもよいピラゾリル基、トリアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、ピラジニル基、ピリダジニル基、インドリル基、インダゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンズイミダゾリル基、イソキノリル基、シンノリニル基、フタラジニル基、キノキサリニル基又はナフチリジニル基であり、Qがシアノ基である請求項1に記載の化合物。

【請求項3】WがそれぞれXnによって置換されてもよいピラゾリル基、トリアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、2-ピリミジニル基、ピラジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基、インドリル基、インダゾリル基、ベンゾチアゾリル基、

ベンゾオキサゾリル基、ベンズイミダゾリル基、キノリル基、イソキノリル基、シンノリニル基、フタラジニル基、キノキサリニル基又はナフチリジニル基であり、Qがエチニル基、基-COR₄又は基-CH(OH) R₄である請求項1に記載の化合物。

【請求項4】WがそれぞれXnによって置換されてもよい、ピラゾリル基、トリアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、2-ピリミジニル基、ピラジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンズイミダゾリル基、キノリル基、フタラジニル基又はキノキサリニル基であり、Qがエチニル基、基-COR₄又は基-CH(OH) R₄である請求項1に記載の化合物。

【請求項5】請求項1~4に記載のヘテロアリアルオキシ(チオ)アルカン酸アミド誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、文献未記載の新規化合物であるヘテロアリアルオキシ(チオ)アルカン酸アミド誘導体及びこれを有効成分として含有する農園芸用殺菌剤に関するものである。

【0002】

【従来の技術】ある種のヘテロアリアルオキシカルボン酸誘導体が生理活性を有することは知られている。例えば、特公昭61-4395公報明細書及び国際公開番号W093/25540号公報明細書にはヘテロアリアル基がベンゾチアゾリル基、2-ピリミジニル基である化合物が除草活性を有することが示されている。また、特開昭63-132867号公報明細書には、ヘテロアリアル基が2-ピリミジニル基、キノリル基である化合物が殺菌活性を有することが示されている。しかしながら、これらの化合物の殺菌活性は満足されるものでなく、本発明化合物のような優れた殺菌活性を有することについては全く記載されていない。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】近年、農園芸用殺菌剤の多用により薬剤に対する耐性菌が出現し、既存の薬剤では十分な殺菌活性を示さないことがある。また、環境問題から低濃度で効率良く有害菌を防除できる新しい殺菌剤が求められている。

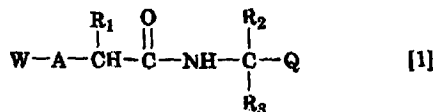
【0004】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、従来知られた殺菌剤に優る殺菌活性を有する薬剤を開発するために、種々の新規なヘテロアリアルオキシ(チオ)アルカン酸アミド誘導体を合成し、その生理活性について検討したところ、本発明化合物がイネいもち病等に対して優れた殺菌活性を有するとともに、有用作物に対しなんら害を及ぼさないことを見出し、本発明を完成するに至った。

【0005】すなわち、本発明は、(1)一般式[1]

【0006】

【化2】



【0007】【式中、WはXnによって置換されてもよいヘテロアリアル基を表し、Aは酸素原子又は硫黄原子を表し、R₁は水素原子、C₁~C₆アルキル基又はC₃~C₆シクロアルキル基を表し、R₂は、C₁~C₆アルキル基又はC₃~C₆シクロアルキル基を表し、R₃は、C₂~C₆アルキル基、C₃~C₆シクロアルキル基(該基はハロゲン原子又はC₁~C₆アルキル基によって置換されていてもよい)、C₃~C₆シクロアルキルC₁~C₆アルキル基又はC₁~C₄ハロアルキル基を表すか、あるいはR₂とR₃は互いに結合してこれらが結合している炭素原子と共に5員~7員環のシクロアルキル基(該基はC₁~C₆アルキル基によって置換されていてもよい。)を形成し、Qはエチニル基、シアノ基、基-COR₄又は基-CH(OH)R₄を表し、R₄はC₁~C₆アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基又はC₃~C₆シクロアルキル基(該基はハロゲン原子又はC₁~C₆アルキル基によって置換されていてもよい。)を表し、XはC₁~C₆アルキル基、C₂~C₆アルケニル基、C₂~C₆アルキニル基、C₃~C₆シクロアルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₆アルコキシ基、C₂~C₆アルケニルオキシ基、C₂~C₆アルキニルオキシ基、C₃~C₆シクロアルキルオキシ基、C₁~C₄ハロアルコキシ基、C₁~C₆アルキルチオ基、C₂~C₆アルケニルチオ基、C₂~C₆アルキニルチオ基、C₃~C₆シクロアルキルチオ基、C₁~C₄ハロアルキルチオ基、ハロゲン原子、フェニル基(該基はC₁~C₆アルキル基、C₁~C₄ハロアルキル基、C₁~C₆アルコキシ基、シアノ基又はハロゲン原子によって置換されていてもよい)、シアノ基又はニトロ基を表し、nは0~4の整数を表す。]にて示されるヘテロアリアルオキシ(チオ)アルカン酸アミド誘導体。

(2)(1)項記載のヘテロアリアルオキシ(チオ)アルカン酸アミド誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤である。

【0008】まず、本明細書において用いられる用語について、以下説明する。なお、本明細書における、例えば「C₁~C₆」等の表記は、これに続く置換基の炭素数が、この場合では1乃至6であることを表している。

【0009】ハロゲン原子とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子を示す。

【0010】C₁~C₆アルキル基とは、直鎖又は分岐鎖状のアルキル基を示し、例えばメチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、n-ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、n-ヘキシル基、イソヘキシル基、3、3-ジメチルブチル基等を挙げることができる。

【0011】C₃~C₆シクロアルキル基とは、例えばシクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等を挙げることができる。

【0012】C₃~C₆シクロアルキルC₁~C₆アルキル基とは、例えばシクロプロピルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基等を挙げることができる。

【0013】C₁~C₄ハロアルキル基とは、ハロゲン原子によって置換された、直鎖又は分岐鎖状のアルキル基を示し、例えばフルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、ジブロモメチル基、トリフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基等を挙げることができる。

【0014】C₂~C₆アルケニル基とは、直鎖又は分岐鎖状のアルケニル基を示し、例えばビニル基、1-プロペニル基、アリル基、イソプロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基等を挙げることができる。

【0015】C₂~C₆アルキニル基とは、直鎖又は分岐鎖状のアルキニル基を示し、例えばエチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、4-メチル-1-ペンチニル基、3-メチル-1-ペンチニル基等を挙げることができる。

【0016】C₁~C₆アルコキシ基とは、直鎖又は分岐鎖状のアルコキシ基を示し、例えばメトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、イソプロポキシ基、n-ブトキシ基、イソブトキシ基、sec-ブトキシ基、tert-ブトキシ基、n-ペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、n-ヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

【0017】C₂~C₆アルケニルオキシ基とは、直鎖又は分岐鎖状のアルケニルオキシ基を示し、例えばアリルオキシ基、イソプロペニルオキシ基、2-ブテニルオキシ基等を挙げることができる。

【0018】C₂~C₆アルキニルオキシ基とは、直鎖又は分岐鎖状のアルキニルオキシ基を示し、例えば2-プロピニルオキシ基、2-ブチニルオキシ基、3-ブチニルオキシ基等を挙げることができる。

【0019】C₃~C₆シクロアルキルオキシ基とは、例えばシクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

【0020】C₁~C₄ハロアルコキシ基とは、ハロゲン原子によって置換された、直鎖又は分岐鎖状のアルコキシ基を示し、例えばフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基等を挙げることができる。

【0021】C₁~C₆アルキルチオ基とは、直鎖又は分岐鎖状のアルキルチオ基を示し、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、n-ブチルチオ基、イソブチルチオ基、sec-ブチルチオ基、tert-ブチルチオ基、n-ヘキシルチオ基等を挙げる

221
21

ことができる。

【0022】 $C_2 \sim C_6$ アルケニルチオ基とは、直鎖又は分岐鎖状のアルケニルチオ基を示し、例えばアリルチオ基、イソプロペニルチオ基、2-ブテニルチオ基等を挙げることができる。

【0023】 $C_2 \sim C_6$ アルキニルチオ基とは、直鎖又は分岐鎖状のアルキニルチオ基を示し、例えば2-プロピニルチオ基、2-ブチニルチオ基、3-ブチニルチオ基等を挙げることができる。

【0024】 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルチオ基とは、例えばシクロプロピルチオ基、シクロペンチルチオ基、シクロヘキシルチオ基等を挙げることができる。

【0025】 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ基とは、ハロゲン原子によって置換された、直鎖又は分岐鎖状のアルキルチオ基を示し、例えばフルオロメチルチオ基、ジフルオロメチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、ペンタフルオロエチルチオ基等を挙げることができる。

【0026】ヘテロアリール基とは、窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれる少なくとも1個のヘテロ原子を含有する単環又は縮合環を示し、例えば、フリル基、チエニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、ビリミジニル基、ピラジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、インドリル基、インダゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンズイミダゾリル基、キノリル基、イソキノリル基、シンノリニル基、フタラジニル基、キノキサリニル基、ナ

フチリジニル基又はベンゾトリアジニル基を挙げることができる。

【0027】一般式[1]で表される本発明化合物の中には、分子内に1個又は2〜3個の不斉炭素原子を有しているものもあり、そのような化合物には光学異性体が存在する。純粋な個々のジアステレオマー、エナンチオマー及びこれらの混合物も本発明化合物に含まれる。

【0028】

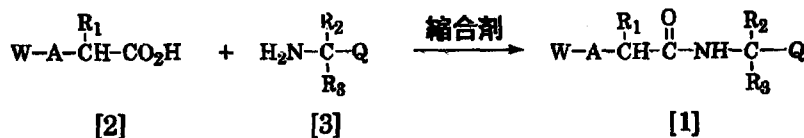
【発明の実施の形態】一般式[1]で表される本発明化合物の好ましい化合物としては、Wがチアゾリル基、チアジアゾリル基、ピラゾリル基、ピラジニル基、ピリダジニル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、フタラジニル基又はキノキサリニル基で、 R_1 が水素原子、メチル基又はエチル基で、Aが酸素原子又は硫黄原子で、 R_2 がメチル基又はエチル基で、 R_3 がエチル基、 n -プロピル基、イソプロピル基、 n -ブチル基、イソブチル基、 sec -ブチル基、 $tert$ -ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基又はジクロロメチル基で、Qがエチニル基、シアノ基、アセチル基又は1-ヒドロキシエチル基で、Xがメチル基、エチル基、 $tert$ -ブチル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はフェニル基である化合物を挙げることができる。

【0029】一般式[1]で示される本発明化合物は、例えば以下に示す製造法に従って製造することができる。

【0030】<製造法1>

【0031】

【化3】



【0032】(式中、W、 R_1 、 R_2 、 R_3 、Q及びAは前記と同じ意味を表す。)

本発明化合物[1]は、一般式[2]で表されるヘテロアリーロキシ(チオ)アルカン酸類を、必要な場合には触媒及び/又は塩基の存在下に、縮合剤を用いて一般式[3]で表されるアミン類と反応させることにより製造することができる。この反応は通常、溶媒中で行われる。

【0033】使用できる溶媒としては、反応を阻害しない溶媒であればよく、例えばペンタン、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、石油エーテル、リグロイン、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の炭化水素類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、アセトン、

メチルエチルケトン、メチルイソプロピルケトン又はメチルイソブチルケトン等のケトン類、酢酸メチル又は酢酸エチル等の酢酸エステル類、アセトニトリル又はプロピオニトリル等のニトリル類、又はジメチルスルホキシド、 N,N -ジメチルホルムアミド又はスルホラン等の非プロトン性極性溶媒、あるいはこれらから選択される溶媒を組み合わせた混合溶媒を用いることができる。

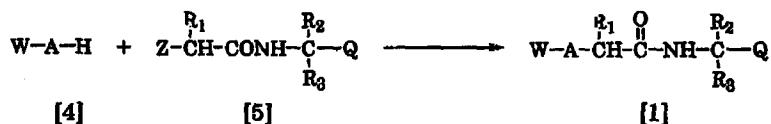
【0034】縮合剤としては、例えば1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩、 N,N' -ジシクロヘキシルカルボジイミド、カルボニルジイミダゾール、2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリウムクロリド等が挙げられる。これらの縮合剤の使用量は、特に制限されるものではないが、好ましくは、一般式[2]で表されるヘテロアリーロキシ(チオ)アルカン酸類に対して1.0〜2.0当量使用される。

【0035】触媒としては、例えば4-ジメチルアミノ

ビリジン、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール等が挙げられる。これらの触媒の使用量は、特に制限されるものではないが、必要な場合には、一般式(2)で表されるヘテロアリアルオキシ(チオ)アルカン酸類に対して10~30モル%使用される。

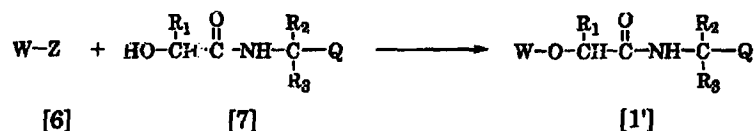
【0036】塩基としては、この型の反応に一般的に用いられるものが使用できる。例えば水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、又はトリエチルアミン、トリメチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ビリジン、N-メチルピペリジン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノン-5-エン(DBN)又は1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン(DBU)等の有機塩基等が挙げられ、好ましくはトリエチルアミン、ビリジン、N-メチルピペリジン等の第三級アミン類が挙げられる。これらの塩基の使用量は、特に制限されるものではないが、必要な場合には、一般式(2)で表されるヘテロアリアルオキシ(チオ)アルカン酸類に対して1.0~2.0当量使用される。

【0037】一般式(2)で表されるヘテロアリアルオキシ(チオ)アルカン酸類と一般式(3)で表されるアミン類



【0042】(式中、W、R₁、R₂、R₃、Q及びAは前記と同じ意味を表し、Zはハロゲン原子、C₁~C₆アルキルスルホニル基、ベンジルスルホニル基等の脱離基を表す。)本発明化合物(1)は、一般式(4)で表されるヘテロアリアル化合物を塩基の存在下に、一般式(5)で表されるアルカン酸アミド誘導体と反応させることにより製造することができる。この反応は通常、溶媒中で行われる。使用できる溶媒としては、製造法1に例示したものと同様の溶媒を使用する事ができる。

【0043】塩基としては、この型の反応に一般的に用いられるものが使用できる。例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、重炭酸ナトリウム、水素化ナトリウム又は水素化カリウム等の無機塩基、又はトリエチルアミン、トリメチルアミン、N,N-ジメチルアニリン又はビリジン等の有機塩基等が挙げられる。これらの塩基の使用量は、特に制限されるものではないが、必要な場合には、一般式(4)で表



【0049】(式中、W、R₁、R₂、R₃、Q及びZは前記と同

は一般的には等モル量使用されるが、どちらか一方を1~50モル%過剰に使用することもある。

【0038】反応温度は、-50℃~150℃の範囲、好ましくは0℃~100℃の範囲において行われる。反応時間は1~30時間が好ましい。

【0039】一般式(2)で表されるヘテロアリアルオキシ(チオ)アルカン酸類は公知の方法(例えば、国際公開番号W098/18766号公報明細書に記載の方法)あるいはそれに準じた方法で製造することができる。また、一般式(3)で表されるアミン類は公知の方法(例えば、オルガニック・シンセシス(Organic Syntheses)、第3巻、第88頁(1955年); ジャーナル オブ ザ ケミカル ソサイエティ、パーキン トランザクションズ.1(Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions.1)、第8巻、第1645頁(1985年); ザ ジャーナル オブ オルガニック ケミストリ(The Journal of Organic Chemistry)、第49巻、第1208頁(1984年)に記載の方法)あるいはそれに準じた方法で製造することができる。

【0040】<製造法2>

【0041】

【化4】

されるヘテロアリアル化合物に対して1.0~2.0当量使用される。

【0044】一般式(4)で表されるヘテロアリアル化合物と一般式(5)で表されるアルカン酸アミド誘導体は一般的には等モル量使用されるが、どちらか一方を1~50モル%過剰に使用することもある。

【0045】反応温度は、-50℃~150℃の範囲、好ましくは0℃~100℃の範囲において行われる。反応時間は1~30時間が好ましい。

【0046】この反応において一般式(5)で表される化合物は、例えばハロゲン化アルカン酸ハライド類と一般式(3)で表されるアミン類とを反応させることで製造することができる。

【0047】<製造法3>

【0048】

【化5】

じ意味を表す。)

223
223

本発明化合物[1']は、一般式[6]で表されるヘテロアリアル化合物を塩基の存在下に、一般式[7]で表されるアルカン酸アミド誘導体と反応させることにより製造することができる。この反応は通常、溶媒中で行われる。

【0050】使用できる溶媒は、製造法1に例示したものと同様の溶媒を使用する事ができ、塩基は製造法2に例示したものと同様の塩基を使用することができ、塩基の使用量は製造法2に例示した使用量と同様でヘテロアリアル化合物に対して1.0~2.0当量使用される。

【0051】一般式[6]で表されるヘテロアリアル化合物と一般式[7]で表されるアルカン酸アミド誘導体は一般的には等モル量使用されるが、どちらか一方を1~50

モル%過剰に使用することもある。反応温度は、-70℃~150℃の範囲、好ましくは-50℃~100℃の範囲において行われる。反応時間は1~30時間が好ましい。

【0052】この反応において一般式[7]で表される化合物は、例えば、一般式[5]で表されるアルカン酸アミド誘導体と酢酸ナトリウムとを反応させて得られるアセトキシアルカン酸アミド誘導体を脱アシル化することで製造することができる。

【0053】<製造法4>

【0054】

【化6】



【0055】(式中、W、R₁、R₂、R₃及びAは前記と同じ意味を表す。)

本発明化合物[1-2]は一般式[1-1]で表されるヘテロアリアルオキシ(チオ)アルカン酸アミド誘導体を、酸の存在下に水和反応を行うことにより製造することができる。この反応は無溶媒、又は溶媒中で行われる。

【0056】使用できる溶媒としては、反応を阻害しない溶媒であればよく、例えばジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソプロピルケトン又はメチルイソブチルケトン等のケトン類、酢酸メチル又は酢酸エチル等の酢酸エステル類、アセトニトリル又はプロピオニトリル等のニトリル類、又はジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド又はス

ルホラン等の非プロトン性極性溶媒、あるいはこれらから選択される溶媒を組み合わせた混合溶媒を用いることができる。

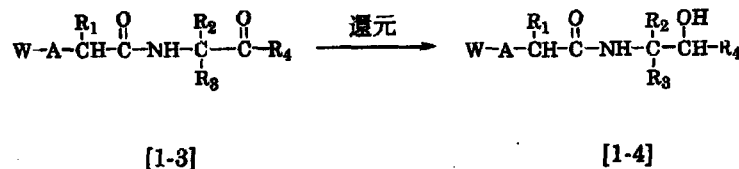
【0057】酸としては、例えば硫酸、塩酸、ギ酸等が挙げられる。これらの酸の使用量は、特に制限されるものではないが、一般式[1-2]で表されるヘテロアリアルオキシ(チオ)アルカン酸誘導体に対して5~50モル%使用される。

【0058】反応温度は、0℃~150℃の範囲、好ましくは20℃~100℃の範囲において行われる。反応時間は1~10時間が好ましい。

【0059】<製造法5>

【0060】

【化7】



【0061】(式中、W、R₁、R₂、R₃、R₄及びAは前記と同じ意味を表す。)

本発明化合物[1-4]は、一般式[1-3]で示されるヘテロアリアルオキシ(チオ)アルカン酸アミド誘導体を還元剤と反応させることにより製造することができる。この反応は通常、溶媒中で行われる。

【0062】使用できる溶媒としては、反応を阻害しない溶媒であればよく、例えば、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、石油エーテル、リグロイン、ベンゼン、トルエン、キシレン等の炭化水素類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化

炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、メタノール、エタノール、2-プロパノール等のアルコール類又は、水とアルコール類との混合溶媒を用いることができる。

【0063】還元剤としては、この型の反応に一般的に用いられるものが使用できる。例えば、水素化ホウ素リチウム、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素カリウム、トリアルキル水素化ホウ素リチウム、トリアルキル水素化ホウ素ナトリウム又はシアノ水素化ホウ素ナトリウム等が挙げられ、好ましくは水素化ホウ素ナトリウムが挙げられる。これらの還元剤の使用量は、特に制限さ

224
24

れるものではないが、好ましくは、一般式[1-3]で表されるヘテロアリールオキシ(チオ)アルカン酸アミド誘導体に対して0.5~2.0当量使用される。

【0064】反応温度は、-70℃~150℃の範囲、好ましくは-20℃~50℃の範囲において行われる。反応時間は1~30時間が好ましい。

【0065】

【実施例】次に、本発明化合物の製造法を具体的に説明する。

【0066】<製造例1>

2-[1-(4-クロロフェニル)-3-メチルピラゾール-5-イルオキシ]-N-(1-シアノ-1,2-ジメチルプロピル)プロピオンアミド(化合物番号A-33)の製造
N,N-ジメチルホルムアミド30mlに1-(4-クロロフェニル)-5-ヒドロキシ-3-メチルピラゾール1.0g、炭酸カリウム1.0gを加えた。この懸濁液に2-ブromo-N-(1-シアノ-1,2-ジメチルプロピル)プロピオンアミド1.2gを加えた。この混合物を80℃で6時間攪拌した後、水にあげ、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下、酢酸エチルを留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物0.6gを得た。融点41-44℃

【0067】<製造例2>

2-(4-クロロフタラジン-1-イルオキシ)-N-(1-シアノ-1,2,2-トリメチルプロピル)プロピオンアミド(化合物番号P-1, P-2)の製造
N,N-ジメチルホルムアミド30mlに2-ヒドロキシ-N-(1-シアノ-1,2,2-トリメチルプロピル)プロピオンアミド0.9gを溶解した。この溶液に60%水素化ナトリウム0.11gを加えた。室温で30分攪拌後、1,4-ジクロロフタラジン0.84gを加えた。この混合物を室温で3時間攪拌した後、水にあげ、ジエチルエーテルで抽出した。ジエチルエーテル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下、ジエチルエーテルを留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物0.13g(ジステレオマーA、融点170-172℃)、0.36g(ジステレオマー混合物、融点182-185℃)を得た。

【0068】<製造例3>

2-(ベンゾチアゾール-2-イルオキシ)-N-(1-イソプロピル-1-メチル-2-オキソプロピル)プロピオンアミド(化合物番号J-14)の製造
テトラヒドロフラン20mlに2-(ベンゾチアゾール-2-イルオキシ)プロピオン酸0.5g、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩0.5gを加えた。室温で30分間攪拌後、3-アミノ-3,4-ジメチル-2-ペンタノン塩酸塩0.4g、トリエチルアミン0.2gを加えた。この混合物を室温で16時間攪拌した後、水にあげ、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下、酢酸エチルを留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、

目的物0.6gを得た。融点133-136℃

【0069】<製造例4>

2-(ベンゾチアゾール-2-イルオキシ)-N-(2-ヒドロキシ-1-イソプロピル-1-メチルプロピル)プロピオンアミド(化合物番号J-15)の製造
メタノール10mlに2-(ベンゾチアゾール-2-イルオキシ)-N-(1-イソプロピル-1-メチル-2-オキソプロピル)プロピオンアミド0.35gを溶解した。この溶液に水素化ホウ素ナトリウム0.08gを氷冷下で加えた。この混合物を室温で5時間攪拌した後、水にあげ、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下、酢酸エチルを留去し、目的物0.2gを得た。屈折率1.5525(20℃)

【0070】<製造例5>

2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)-N-(1-イソプロピル-1-メチル-2-プロピニル)プロピオンアミド(化合物番号F-10)の製造
テトラヒドロフラン30mlに2-ヒドロキシ-N-(1-イソプロピル-1-メチル-2-プロピニル)プロピオンアミド0.8gを溶解した。この溶液に60%水素化ナトリウム0.18gを加えた。室温で30分攪拌後、2-メチルスルホニル-4,6-ジメトキシピリミジン1.0gを加えた。この混合物を室温で4時間攪拌した後、水にあげ、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下、酢酸エチルを留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物0.6gを得た。融点98-101℃

【0071】<製造例6>

2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)-N-(1-イソプロピル-1-メチル-2-オキソプロピル)プロピオンアミド(化合物番号F-11)の製造
アセトニトリル40mlに2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルオキシ)-N-(1-イソプロピル-1-メチル-2-プロピニル)プロピオンアミド0.4g、10%塩酸5mlを加えた。この混合物を還流下2時間攪拌した後、水にあげ、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下、酢酸エチルを留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物0.2gを得た。融点103-106℃

次に、一般式[1]で表される本発明化合物の具体例及び実施例を表1~表19に示すが、これらに限られるものではない。

【0072】表中の記号はそれぞれ以下の意味を示す。
Meとはメチル基を示し、Etとはエチル基を示し、Prとはn-プロピル基を示し、Pr-iとはイソプロピル基を示し、Buとはn-ブチル基を示し、Bu-iとはイソブチル基を示し、Bu-sとはsec-ブチル基を示し、Bu-tとはtert-ブチル基を示し、Pr-cとはシクロプロピル基を示し、Pen-cとはシクロペンチル基を示し、Phとはフェニル基を示す。また、例えばPh(4-Cl)とは4-クロロフェニル基を示す。

225
225

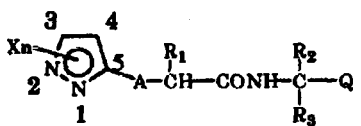
す。

【0073】なお、異性体AとはジアステレオマーA、異性体BとはジアステレオマーBをそれぞれ表し、異性体Mとはジアステレオマー混合物を表す。ジアステレオマーAとはシリカゲルカラムクロマトグラフィー又は高速液

体クロマトグラフィー等によって分離された低極性のジアステレオマーを示し、ジアステレオマーBとは同様に分離された高極性のジアステレオマーを示す。

【0074】

【表1】

							
化合物 番号	Xn	A	R ₁	R ₂	R ₃	Q	異性体 融点(℃) or 屈折率(n _D ²⁰)
A-1	1,3-(Me) ₂	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 1.4915
A-2	1,3-(Me) ₂ ,4-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 1.4971
A-3	1,3,4-(Me) ₃	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 1.492
A-4	1-Bu-t,3-Me	O	Me	Me	Bu-t	CN	M 1.4721
A-5	1-Bu-t,3-Me	O	Me	Me	Bu-t	COMe	M 1.4761
A-6	1-Bu-t,3-Me	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 1.4761
A-7	1-Bu-t,3-Me	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M 1.4761
A-8	1-Me,3-CF ₃	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 111-113
A-9	1-Me,3-CF ₃ ,4-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 1.4689
A-10	1-Ph(2-Cl),3-CF ₃	O	Me	Me	Bu-t	CN	M 1.5038
A-11	1-Ph(2-Cl),3-CF ₃	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 68-71
A-12	1-Ph(2-Cl),3-Me	O	Me	Me	Bu-t	CN	M 1.5145
A-13	1-Ph(2-Cl),3-Me	O	Me	Me	Pr-i	CN	M アメ状物質
A-14	1-Ph(3-Cl),3-CF ₃	O	Me	Me	Bu-t	CN	M 1.4994
A-15	1-Ph(3-Cl),3-CF ₃	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 1.5012
A-16	1-Ph(3-Cl),3-CF ₃	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M 102-105
A-17	1-Ph(3-Cl),3-CF ₃	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M 1.4999
A-18	1-Ph(3-Cl),3-Me	O	Me	Me	Bu-t	CN	M 95-98
A-19	1-Ph(3-Cl),3-Me	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 114-117
A-20	1-Ph(3-Cl),3-Me	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M 103-106
A-21	1-Ph(3-Cl),3-Me	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M 1.5434
A-22	1-Ph(3-F),3-Me	O	Me	Me	Bu-t	CN	M 105-106
A-23	1-Ph(3-F),3-Me	O	Me	Me	Bu-t	CN	M 120-123
A-24	1-Ph(3-F),3-Me	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 128-131
A-25	1-Ph(3-F),3-Me	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 107-109
A-26	1-Ph(3-Me),3-Me	O	Me	Me	Bu-t	CN	M アメ状物質
A-27	1-Ph(3-Me),3-Me	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 1.5331
A-28	1-Ph(4-Cl),3-CF ₃	O	Me	Me	Bu-t	CN	M 138-140
A-29	1-Ph(4-Cl),3-CF ₃	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 48-51
A-30	1-Ph(4-Cl),3-CF ₃	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M 147-150

【0075】

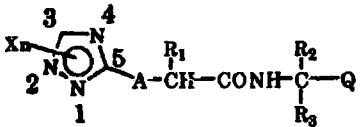
【表2】

226
26

化合物 番号	Xn	A	R ₁	R ₂	R ₃	Q	異性体	融点(°C) or 屈折率(n _D ²⁰)
A-31	1-Ph(4-Cl),3-CF ₃	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M	1.5071
A-32	1-Ph(4-Cl),3-Me	O	Me	Me	Bu-t	CN	M	48-51
A-33	1-Ph(4-Cl),3-Me	O	Me	Me	Pr-i	CN	M	41-44
A-34	1-Ph(4-Cl),3-Me	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M	98-101
A-35	1-Ph(4-Cl),3-Me	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M	アメ状物質
A-36	1-Ph(4-F),3-Me	O	Me	Me	Bu-t	CN	M	アメ状物質
A-37	1-Ph(4-F),3-Me	O	Me	Me	Pr-i	CN	M	1.5169
A-38	1-Ph,3-CF ₃	O	Me	Me	Bu-t	COMe		
A-39	1-Ph,3-CF ₃	O	Me	Et	Et	COEt		
A-40	1-Ph,3-CF ₃	O	Pr-c	Et	Et	COMe		
A-41	1-Ph,3-CF ₃	O	Me	Et	Et	COPr-c		
A-42	1-Ph,3-CF ₃	O	H	Me	Pr-c	COMe		
A-43	1-Ph,3-CF ₃	O	Me	Me	Pr-i	CN	M	133-135
A-44	1-Ph,3-CF ₃	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M	119-122
A-45	1-Ph,3-CF ₃	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M	1.5015
A-46	1-Ph,3-CF ₃	S	Me	Me	Pr-i	COMe		
A-47	1-Ph,3-CF ₃	O	H	Me	Pr-i	COMe		
A-48	1-Ph,3-CF ₃ ,4-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN	M	1.5062
A-49	1-Ph,3-Me	O	Me	Me	Pr-i	CN	M	153-155
A-50	1-Ph,3-Me	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M	89-92
A-51	1-Ph,3-Me	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M	1.5349
A-52	1-Ph,3-Me,4-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN	M	1.5546
A-53	1-Ph(4-OMe),3-Me	O	Me	Me	Pr-i	CN		
A-54	1-Ph(4-CF ₃),3-Me	O	Me	Me	Pr-i	CN		

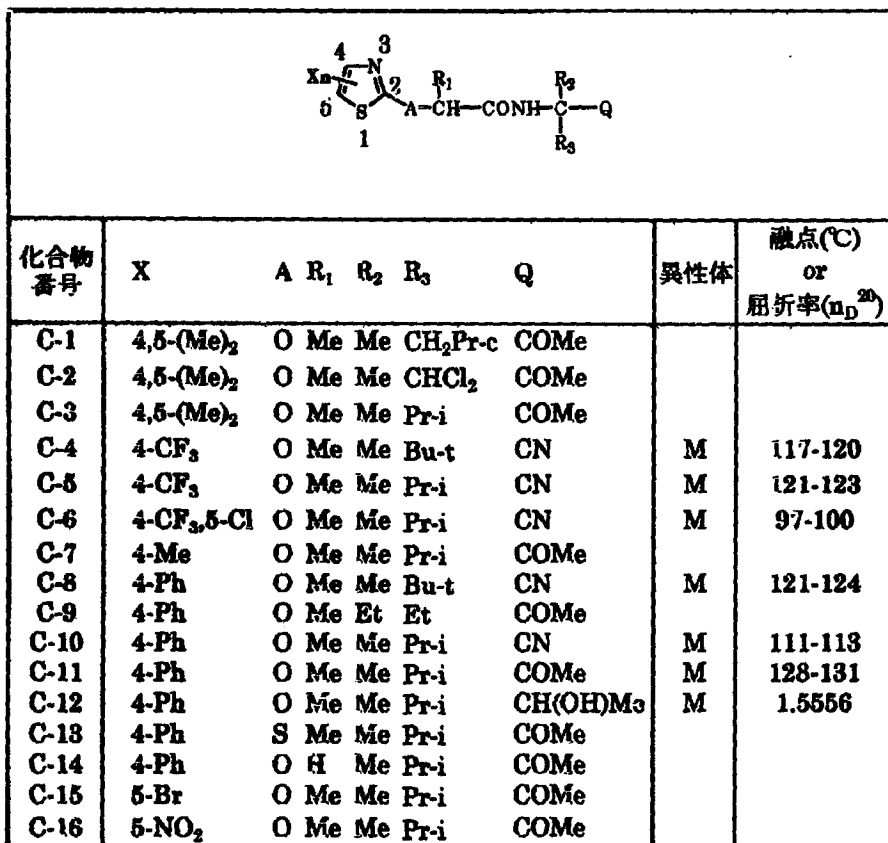
【0076】

【表3】

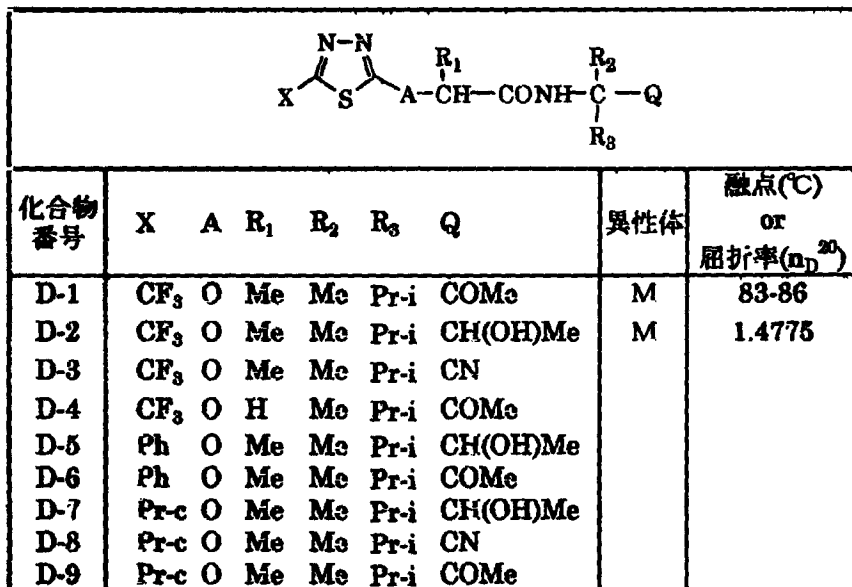
								
化合物 番号	Xn	A	R ₁	R ₂	R ₃	Q	異性体	融点(°C) or 屈折率(n _D ²⁰)
B-1	1-Me,4-Ph(4-Cl)	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me		
B-2	1-Me,4-Ph(4-Cl)	O	Me	Me	Pr-i	CN		
B-3	1-Me,4-Ph(4-Cl)	O	Me	Me	Pr-i	COMe		
B-4	1-Ph,3-Me	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M	102-104
B-5	1-Ph,3-Me	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M	1.5183
B-6	1-Ph,3-Me	S	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me		
B-7	1-Ph,3-Me	O	Me	Me	Pr-i	CN		
B-8	1-Ph,3-Me	S	Me	Me	Pr-i	COMe		
B-9	1-Ph,3-Me	O	H	Me	Pr-i	COMe		
B-10	1-Ph,3-Me	O	Et	Me	Pr-i	COMe		
B-11	1-Ph(4-CN),3-Me	O	H	Me	Pr-i	COMe		
B-12	1-Ph(4-CF ₃),3-Me	O	H	Me	Pr-i	COMe		

【0077】

【表4】



【表5】



【表6】

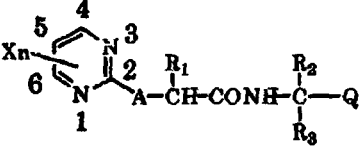
228
700

$ \begin{array}{c} \text{X} \\ \diagdown \\ \text{N} \\ \diagup \\ \text{N} \quad \text{S} \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{A} - \text{CH}(\text{R}_1) - \text{CONH} - \text{C}(\text{R}_2)(\text{R}_3) - \text{Q} \end{array} $								
化合物 番号	X	A	R ₁	R ₂	R ₃	Q	異性体	融点(°C) or 屈折率(n _D ²⁰)
E-1	Ph	O	Me	Me	Bu-t	CN	M	103-106
E-2	Ph	O	Me	Me	Bu-t	COMe		
E-3	Ph	O	Me	Me	Bu-t	CH(OH)Me		
E-4	Ph	O	Me	Me	Pr-i	CN	M	123-126
E-5	Ph	O	H	Me	Pr-i	COMe		
E-6	Ph	O	Me	Me	Pr-i	COMe		
E-7	Ph	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me		
E-8	SMe	O	Me	Me	Pr-i	COMe		
E-9	SMe	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me		

【0080】

【表7】

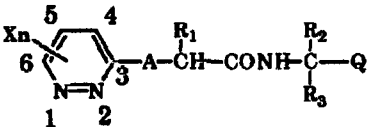
229
229

							
化合物 番号	X _n	A	R ₁	R ₂	R ₃	Q	融点(°C) or 屈折率(n _D ²⁰)
F-1	H	O	Me	Me	Pr-i	C≡CH	M 1.5079
F-2	H	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M 98-101
F-3	H	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M 1.5031
F-4	4,6-(Me) ₂	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M 107-108
F-5	4,6-(Me) ₂	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M 1.4998
F-6	4,6-(OCH ₂ C≡CH) ₂	O	H	Et	Et	COMe	
F-7	4,6-(OCH ₂ CH=CH ₂) ₂	O	H	Et	Et	COMe	
F-8	4,6-(OEt) ₂	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M 112-115
F-9	4,6-(OEt) ₂	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M 1.4989
F-10	4,6-(OMe) ₂	O	Me	Me	Pr-i	C≡CH	M 98-101
F-11	4,6-(OMe) ₂	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M 103-106
F-12	4,6-(OMe) ₂	O	Me	(CH ₂) ₄		COMe	
F-13	4,6-(OMe) ₂	O	Me	(CH ₂) ₅		COMe	
F-14	4,6-(OMe) ₂ ,5-Br	O	Me	Et	Et	COMe	
F-15	4,6-(OMe) ₂ ,5-Br	O	Me	Me	Pr-i	C≡CH	M 127-130
F-16	4,6-(OMe) ₂ ,5-Br	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M 141-144
F-17	4,6-(OMe) ₂ ,5-Br	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M 1.5213
F-18	4,6-(OMe) ₂ ,5-Br	S	Me	Me	Pr-i	COMe	
F-19	4,6-(OMe) ₂ ,5-Br	O	Et	Me	Pr-i	COMe	
F-20	4,6-(OMe) ₂ ,5-Br	O	Me	Me	Pr-i	COEt	
F-21	4,6-(OMe) ₂ ,5-Br	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Et	
F-22	4,6-(OMe) ₂ ,5-Br	O	Me	Me	Pr-i	C≡CH	
F-23	4,6-(OMe) ₂ ,5-Br	O	Me	Me	Pr-i	COMe	
F-24	4,6-(OMe) ₂ ,5-Br	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	
F-25	4-CF ₃	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M 103-106
F-26	4-CF ₃ ,5-Cl,6-OMe	O	Me	Me	Pr-i	COMe	
F-27	4-CF ₃ ,6-OMe	O	Me	Me	Pr-i	COMe	
F-28	4-Me,6-CH=CH ₂	O	Me	Me	Pr-i	COMe	
F-29	4-Me,6-CH≡CMe	O	Me	Me	Pr-i	COMe	

【0081】

【表8】

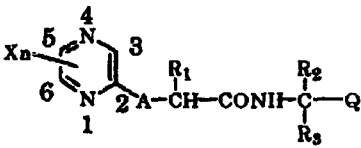
230
230

							
化合物 番号	Xn	A	R ₁	R ₂	R ₃	Q	異性体 融点(°C) or 屈折率(n _D ²⁰)
G-1	4,5-(Cl) ₂ ,6-Ph	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 51-54
G-2	4,5-(Me) ₂ ,6-Cl	O	Me	Me	Bu-t	CN	M 100-102
G-3	4,5-(Me) ₂ ,6-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 137-139
G-4	4,5-(Me) ₂ ,6-Cl	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M 145-148
G-5	4,5-(Me) ₂ ,6-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M 132-135
G-6	4,5-(Me) ₂ ,6-Cl	O	H	Me	Pr-i	COMe	
G-7	4,5-(Me) ₂ ,6-Cl	O	Me	Me		COMe	
G-8	4-Me,6-Cl	O	Me	Me	Bu-t	CN	M 120-123
G-9	4-Me,6-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 133-136
G-10	5-Me,6-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 119-122
G-11	6-Cl	O	Me	Me	Bu-t	CN	M 111-113
G-12	6-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 135-138
G-13	6-Cl	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M 104-107
G-14	6-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M 122-125
G-15	6-OMe	O	Me	Me	Pr-i	COMe	
G-16	6-OMe	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	
G-17	6-OPen-c	O	Me	Et	Et	COMe	
G-18	6-Ph	O	Me	Me	Bu-t	CN	M 158-161
G-19	6-Ph	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 155-158
G-20	6-SPen c	O	Me	Et	Et	COMe	

【0082】

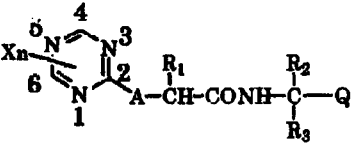
【表9】

231
231

								
化合物 番号	X _n	A	R ₁	R ₂	R ₃	Q	異性体	融点(°C) or 屈折率(n _D ²⁰)
H-1	3-Cl	O	Me	Me	Pr-i	C≡CH	M	72-75
H-2	3-Cl	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M	115-118
H-3	3-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M	1.5195
H-4	3-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN		
H-5	3-SMe	O	Me	Me	Pr-i	COMe		
H-6	5,6-(CN) ₂	O	Me	Me	Pr-i	C≡CH		
H-7	5,6-(CN) ₂	O	Me	Me	Pr-i	COMe		
H-8	5,6-(CN) ₂	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me		
H-9	6-Cl	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M	106-109
H-10	6-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M	1.5021
H-11	6-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN		

【0083】

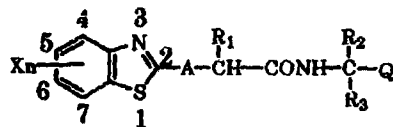
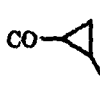
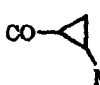
【表10】

								
化合物 番号	Xn	A	R ₁	R ₂	R ₃	Q	異性体	融点(°C) or 屈折率(n _D ²⁰)
I-1	4,6-(OEt) ₂	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M	88-91
I-2	4,6-(OMe) ₂	O	Me	Me	Pr-i	COMe		
I-3	4,6-(OMe) ₂	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me		
I-4	4,6-(SCH ₂ C≡CH) ₂	O	H	Et	Et	COMe		
I-5	4,6-(SCH ₂ CH=CH ₂) ₂	O	H	Et	Et	COMe		
I-6	4,6-(SEt) ₂	O	H	Et	Et	COMe		

【0084】

【表11】

232
23

							
化合物 番号	X _n	A	R ₁	R ₂	R ₃	Q	異性体 熔点(°C) or 屈折率(n _D ²⁰)
J-1	H	O	Me	Me	Bu-t	CN	A 1.5551
J-2	H	O	Me	Me	Bu-t	CN	B 143-145
J-3	H	S	Me	Me	Bu-t	CN	A 95-96
J-4	H	S	Me	Me	Bu-t	CN	B 1.5861
J-5	H	O	H	Et	Et	COEt	
J-6	H	O	H	Et	Et	COCH ₂ Cl	
J-7	H	O	H	Pr-c	Pr-c	COMe	
J-8	H	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 1.575
J-9	H	S	Me	Me	Pr-i	CN	A 113-114
J-10	H	S	Me	Me	Pr-i	CN	B 107-109
J-11	H	O	Me	Me	Pr-i	CN	A 123-125
J-12	H	O	Me	Me	Pr-i	CN	B 139-140
J-13	H	O	Me	Me	Pr-i	C≡CH	M 124-127
J-14	H	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M 133-136
J-15	H	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M 1.5525
J-16	H	S	Me	Me	Pr-i	C≡CH	
J-17	H	S	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	
J-18	H	S	Me	Me	Pr-i	COMe	
J-19	H	O	Me	Me	Pr-i	COPr-c	
J-20	H	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Pr-c	
J-21	H	O	Me	Me		COMe	
J-22	H	O	Me	Me	Pr-i		
J-23	H	O	Me	Me	Pr-i		
J-24	4-CF ₃	O	Me	Me	Bu-t	CN	M 125-128
J-25	4-CF ₃	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 122-125
J-26	4-Cl	O	Me	Me	Bu-t	CN	M 115-118
J-27	4-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN	M 119-121
J-28	4-Cl	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M 137-140
J-29	4-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M 1.5622

【0085】

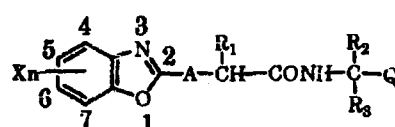
【表12】

化合物 番号	Xn	A	R ₁	R ₂	R ₃	Q	異性体	融点(℃) or 屈折率(n _D ²⁰)
J-30	4-Me	O	Me	Me	Bu-t	CN	M	59-62
J-31	4-Me	O	Me	Me	Pr-i	CN	M	67-70
J-32	4-Me	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M	130-133
J-33	4-Me	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M	1.5541
J-34	4-OMe	O	Me	Me	Bu-t	CN	M	1.5501
J-35	4-OMe	O	Me	Me	Pr-i	CN	M	1.5508
J-36	4-Pr-i	O	Me	Me	Pr-i	CN	M	1.5469
J-37	5-Cl	S	Me	Me	Pr-i	CN	A	191-192
J-38	5-Cl	S	Me	Me	Pr-i	CN	B	1.5913
J-39	5-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN	M	40-42
J-40	6-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN	A	104-106
J-41	6-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN	B	129-130
J-42	6-Cl	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M	140-143
J-43	6-F	O	Me	Me	Pr-i	CN	M	91-93
J-44	6-OCF ₃	O	Et	Me	Pr-i	COMe		
J-45	6-SCF ₃	O	Et	Me	Pr-i	COMe		
J-46	7-Cl	O	Me	Me	Bu-t	CN	M	アメ状物質
J-47	7-Cl	O	Me	Me	Bu-t	CN	M	151-154
J-48	7-Cl	O	Me	Me	Bu-t	CN	M	105-108
J-49	7-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN	M	115-117
J-50	7-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN	M	151-154
J-51	7-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN	M	119-122
J-52	7-Cl	O	Me	(CH ₂) ₄		CN		
J-53	7-Cl	O	Me	CH(Me)(CH ₂) ₃		CN		

【0086】

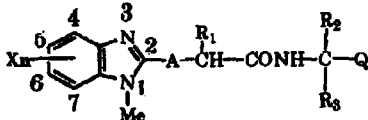
【表13】

234
234

								
化合物 番号	Xn	A	R ₁	R ₂	R ₃	Q	異性体	融点(°C) or 屈折率(n _D ²⁰)
K-1	H	O	Me	Me	Bu-t	CN	M	102-105
K-2	H	O	H	Et	Et	COEt		
K-3	H	O	Me	Me	Pr-i	CN	A	113-116
K-4	H	O	Me	Me	Pr-i	CN	B	151-153
K-5	H	O	Me	Me	Pr-i	C≡CH	M	80-83
K-6	H	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M	133-136
K-7	H	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M	1.5191
K-8	H	S	H	Me	Bu-i	CN		
K-9	H	S	H	Me	Bu-s	CN		
K-10	H	S	H	Me	Bu	CN		
K-11	H	O	Me	Me	Pr-i	COPr c		
K-12	δ-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN		
K-13	δ-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me		
K-14	δ-Cl	O	Me	Me	Pr-i	COMe		

【0087】

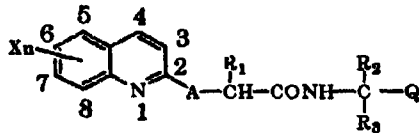
【表14】

								
化合物 番号	Xn	A	R ₁	R ₂	R ₃	Q	異性体	融点(°C) or 屈折率(n _D ²⁰)
L-1	H	O	Me	Me	Bu-t	CN	A	139-142
L-2	H	O	Me	Me	Bu-t	CN	B	109-112
L-3	H	O	Me	Me	Bu-t	COMe		
L-4	H	O	Me	Me	Bu-t	CH(OH)Me		
L-5	H	O	Me	Me	Pr-i	CN	A	111-113
L-6	H	O	Me	Me	Pr-i	CN	B	142-145
L-7	H	O	Me	Me	Pr-i	COMe		
L-8	H	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me		

【0088】

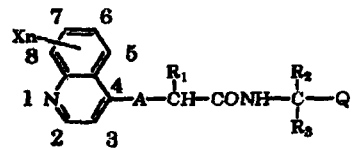
【表15】

238
235

							
化合物 番号	Xn	A	R ₁	R ₂	R ₃	Q	異性体 融点(°C) or 屈折率(n _D ²⁰)
M-1	H	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M 137-140
M-2	H	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M 1.5539
M-3	H	O	Me	Me	Pr-i	COCH ₂ Cl	
M-4	H	O	H	Me	Pr-i	COEt	
M-5	H	O	H	Me	Pr-i	COPr	

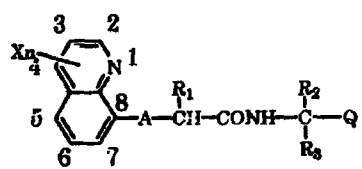
【0089】

【表16】

							
化合物 番号	Xn	A	R ₁	R ₂	R ₃	Q	異性体 融点(°C) or 屈折率(n _D ²⁰)
N-1	H	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M 139-142
N-2	H	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M 71-74
N-3	2-Me	O	Me	Me	Et	COMe	
N-4	7-CF ₃	O	Me	Me	Et	COMe	

【0090】

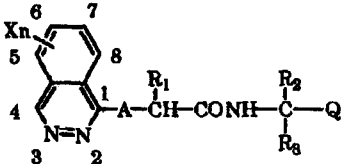
【表17】

							
化合物 番号	Xn	A	R ₁	R ₂	R ₃	Q	異性体 融点(°C) or 屈折率(n _D ²⁰)
O-1	H	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M 1.5565
O-2	H	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M 1.5528
O-3	H	S	Me	Me	Pr-i	COMe	
O-4	5,7-(Cl) ₂	O	Me	Et	Et	COMe	
O-5	5-F	O	Me	Et	Et	COMe	

【0091】

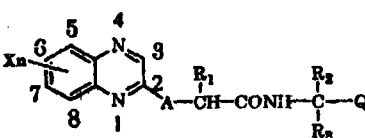
【表18】

236
236

								
化合物 番号	Xn	A	R ₁	R ₂	R ₃	Q	異性体	融点(℃) or 屈折率(n _D ²⁰)
P-1	4-Cl	O	Me	Me	Bu-t	CN	A	170-172
P-2	4-Cl	O	Me	Me	Bu-t	CN	M	182-185
P-3	4-Cl	O	Me	Me	Bu-t	COMe		
P-4	4-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN	M	138-141
P-5	4-Cl	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M	185-188
P-6	4-Cl	O	H	Me	Pr-i	COMe		
P-7	4-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me		
P-8	4-OMe	O	Me	Me	Bu-t	CN	A	70-72
P-9	4-OMe	O	Me	Me	Bu-t	CN	B	アメ状物質
P-10	4-OMe	O	Me	Me	Bu-t	COMe		
P-11	4-OMe	O	Me	Me	Pr-i	CN	M	アメ状物質
P-12	4-OMe	O	Me	Me	Pr-i	COMe		
P-13	4-OPen-c	O	Me	Me	Pr-i	CN		

【0092】

【表19】

								
化合物 番号	Xn	A	R ₁	R ₂	R ₃	Q	異性体	融点(℃) or 屈折率(n _D ²⁰)
Q-1	H	O	Me	Me	Pr-i	CN		
Q-2	3-CF ₃	O	H	Et	Et	COMe		
Q-3	3-Cl	O	Me	Me	Bu-t	CN	M	129-132
Q-4	3-Cl	O	Me	Me	Pr-i	CN	M	120-123
Q-5	3-Cl	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M	187-190
Q-6	3-Et	O	Me	Me	Pr-i	COMe	M	137-140
Q-7	3-Et	O	Me	Me	Pr-i	CH(OH)Me	M	1.5457
Q-8	3-Me	O	Me	Me	Pr-i	COMe		

【0093】本発明の農園芸用殺菌剤は、一般式〔1〕で示されるヘテロアリールオキシ（チオ）アルカン酸アミド誘導体を有効成分として含有してなる。本発明化合物を農園芸用殺菌剤として使用する場合には、その目的に応じて有効成分を適当な剤型で用いることができる。通常は有効成分を不活性な液体または固体の担体で希釈し、必要に応じて界面活性剤、その他をこれに加え、粉剤、水和剤、乳剤、粒剤等の製剤形態で使用できる。有効成分の配合割合は必要に応じて適宜選ばれるが、粉剤及

び粒剤とする場合は0.1～20%（重量）、また、乳剤及び水和剤とする場合は5～80%（重量）が適当である。

【0094】好適な担体としては、例えばタルク、ベントナイト、クレイ、カオリン、珪藻土、ホワイトカーボン、パーミキュライト、消石灰、珪砂、硫酸、尿素等の固体担体、イソプロピルアルコール、キシレン、シクロヘキサノン、メチルナフタレン等の液体担体等があげられる。界面活性剤及び分散剤としては、例えばジナフチ

237
237

ルメタンスルホン酸塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルアリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、ポリオキシエチレングリコールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンソルビタンモノアルキレート等があげられる。補助剤としてはカルボキシメチルセルロース等があげられる。

【0095】本発明の農園芸用殺菌剤は、これらの製剤をそのまま、あるいは希釈して茎葉散布、種子処理、土壌施用、水面施用または育苗箱施用等により使用することができる。これらの施用量は、使用される化合物の種類、対象病害、発生傾向、被害の程度、環境条件、使用する剤型などによって変動する。例えば粉剤及び粒剤のようにそのまま使用する場合には、有効成分で10アール当たり0.1g~5kg、好ましくは1g~1kgの範囲から適宜選ぶのがよい。また、乳剤及び水和剤のように液状で使用する場合には、0.1ppm~10,000ppm、好ましくは10~3,000ppmの範囲から適宜選ぶのがよい。

【0096】本発明による化合物は上記の施用形態により、藻菌類(Oomycetes)、子囊菌類(Ascomycetes)、担子菌類(Basidiomycetes)、及び不完全菌類(Deuteromycetes)に属する菌に起因する植物の病害を防除できる。次に、具体的な菌名を非限定例としてあげる。シュウドペロノスポラ(Pseudoperonospora)属菌、例えばキュウリバと病菌(Pseudoperonospora cubensis)、ベンチュリア(Venturia)属菌、例えばリング黒星病菌(Venturia ainaequalis)、エリシフェ(Erysiphe)属菌、例えばコムギうどんこ病菌(Erysiphe graminis)、ピリキュラリア(Pyricularia)属菌、例えばイネいもち病菌(Pyricularia oryzae)、ボトリチス(Botrytis)属菌、例えばキュウリ灰色かび病菌(Botrytis cinerea)、リゾクトニア(Rhizoctonia)属菌、例えばイネ紋枯病菌(Rhizoctonia solani)、パクシニア(Puccinia)属菌、例えばコムギ赤さび病菌(Puccinia recondita)。

【0097】さらに、本発明の化合物は必要に応じて殺虫剤、他の殺菌剤、除草剤、植物生長調節剤、肥料等と混合してもよい。次に、本発明の農園芸用殺菌剤の代表的な製剤例をあげて、製剤方法を具体的に説明する。以下の説明において「%」は重量百分率を示す。

【0098】製剤例1 粉剤

化合物(J-14)2%、珪藻土5%及びクレー93%を均一に混合粉碎して粉剤とした。

【0099】製剤例2 水和剤

化合物(J-14)50%、珪藻土45%、ジナフチルメタンジスルホン酸ナトリウム2%及びリグニンスルホン酸ナトリウム3%を均一に混合粉碎して水和剤とした。

【0100】製剤例3 乳剤

化合物(J-14)30%、シクロヘキサノン20%、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル11%、アルキルベンゼンスルホン酸カルシウム4%及びメチルナフタリン35%を均一に溶解して乳剤とした。

【0101】製剤例4 粒剤

化合物(J-14)5%、ラウリルアルコール硫酸エステルのナトリウム塩2%、リグニンスルホン酸ナトリウム5%、カルボキシメチルセルロース2%及びクレー86%を均一に混合粉碎する。この混合物に水20%相当量を加えて練合し、押出式造粒機を用いて14~32メッシュの粒状に加工したのち、乾燥して粒剤とした。

【0102】次に、本発明の農園芸用殺菌剤の奏する効果を試験例をあげて具体的に説明する。

【0103】試験例1 イネいもち病予防効果試験

直径7cmの素焼鉢各々に、イネ種子(品種:愛知旭)を15粒ずつ播種し、温室内で育成した。第4葉が完全に展開したイネ苗に、製剤例2に準じて調製した水和剤を、有効成分濃度が500ppmになるように水で希釈し、1鉢当たり10ml散布した。風乾後、イネいもち病菌(Pyricularia oryzae)の分生孢子懸濁液を噴霧接種し、直ちに25℃の温室内に24時間入れた。その後温室内に移し、接種5日後に第4葉の病斑数を調査した。数1により防除価を求め、表20の基準により評価した。結果を表21に示した。

【0104】

【数1】

$$\text{防除価}(\%) = \left(1 - \frac{\text{処理区の病斑数}}{\text{無処理区の病斑数}}\right) \times 100$$

【0105】

【表20】

評価	
A:	防除価100%
B:	防除価100%未満~80.0%以上
C:	防除価80.0%未満~50.0%以上
D:	防除価50.0%未満

【0106】

【表21】

238
238

化合物No.	評価	化合物No.	評価
A-11	B	J-2	B
A-14	B	J-3	B
A-15	B	J-4	B
A-18	B	J-8	A
A-19	A	J-9	B
A-20	B	J-10	B
A-21	B	J-11	A
A-22	B	J-12	B
A-23	B	J-13	B
A-24	B	J-14	A
A-27	B	J-15	A
A-28	B	J-24	B
A-29	B	J-25	B
A-30	B	J-26	B
A-31	B	J-27	A
A-32	B	J-28	A
A-33	A	J-29	A
A-34	B	J-30	A
A-35	B	J-31	A
A-36	B	J-32	A
A-37	A	J-33	A
A-43	B	J-34	B
A-44	B	J-35	A
A-45	B	J-36	B
A-49	B	J-39	A
A-50	B	J-40	B
H-4	B	J-43	A
C-6	A	J-45	A
C-10	B	J-48	A
C-12	B	J-49	A
I-1	B	J-51	A
I-4	B	K-1	B
F-4	B	K-3	B
F-8	B	K-4	B
F-10	B	M-1	B
F-11	B	M-2	B
F-15	A	N-1	B
F-16	A	O-1	A
F-17	A	O-2	A
F-25	B	P-1	B
G-4	B	P-2	B
G-8	B	P-4	B
G-10	B	Q-3	B
H-2	B	Q-4	B
H-9	A	Q-5	B
J-1	A	Q-6	B

【0107】試験例2 イネいもち病水面施用試験
直径9cmの白磁鉢に1.5葉期の水稻(品種:愛知旭)稚苗を3茎ずつ4カ所に移植し、温室内で育成した。2.5葉期に製剤例2に準じて調製した水和剤を有効成分濃度が10アールあたり100gになるように鉢に水面施用処理をした。処理10日後に、イネいもち病菌(*Pyricularia oryzae*)の分生孢子懸濁液を噴霧接種し、直ちに25℃の温室内に24時間入れた。その後、温室内に移し、接種5日後に接種時の最高位葉の病斑数を調査した。数1により防除値を求め、表20の基準により評価した結果を表22に示した。

【0108】

【表22】

化合物No.	評価
I-16	B
I-17	B
G-4	A
J-11	B
J-14	B
J-15	B
J-28	B
J-32	B

【0109】試験例3 コムギうどんこ病予防効果試験
直径6cmのプラスチックポット各々に、コムギ種子(品種:農林61号)を10粒ずつ播種し、温室内で育成した。2葉が展開したコムギ苗に、製剤例2に準じて調製した水和剤を、有効成分濃度が500ppmになるように水で希釈し、1ポット当たり10ml散布した。風乾後、コムギうどんこ病菌(*Erysiphe graminis*)の胞子を接種し、温室内で管理した。接種10日後にポット全体の第1葉の発病面積を調査し、表23の基準により評価した。結果を表24に示した。

【0110】

【表23】

評価	
A:	発病を認めず
B:	発病は認められるが、発病面積が5%未満
C:	発病面積5%以上10%未満
D:	発病面積10%以上

【0111】

【表24】

239
239

化合物No.	評価
A-9	B
A-16	A
A-17	B
A-20	A
A-21	B
A-30	A
A-31	B
A-34	A
F-2	B
F-3	B
F-4	B
G-13	B
G-14	B
H-9	A
H-10	B

【0112】

【発明の効果】本発明の農園芸用殺菌剤は、イネいもち病、コムギうどんこ病等に対して高い防除効果を有し、しかも、作物に薬害を生ずることなく、残効性、耐雨性に優れるという特徴をも併せ持っているため、農園芸用殺菌剤として有用である。

【手続補正書】

【提出日】平成12年9月18日(2000.9.18)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】請求項3

【補正方法】変更

【補正内容】

【請求項3】 R_1 は $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基を表し、 W がそれぞれ Xn によって置換されてもよいピラゾリル基、トリアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、2-ピリミジニル基、ピラジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基、インドリル基、インダゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンズイミダゾリル基、キノリル基、イソキノリル基、シンノリニル基、フタラジニル基、キノキサリニル基又はナフチリジニル基であ

り、 Q がエチニル基、基- COR_4 又は基- $CH(OH)R_4$ である請求項1に記載の化合物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】請求項4

【補正方法】変更

【補正内容】

【請求項4】 R_1 は $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基を表し、 W がそれぞれ Xn によって置換されてもよい、ピラゾリル基、トリアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、2-ピリミジニル基、ピラジニル基、ピリダジニル基、トリアジニル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンズイミダゾリル基、キノリル基、フタラジニル基又はキノキサリニル基であり、 Q がエチニル基、基- COR_4 又は基- $CH(OH)R_4$ である請求項1に記載の化合物。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.⁷

識別記号

F I

(参考)

A01N 43/56

A01N 43/56

D

43/58

43/58

A

E

43/60

43/60

101

101

43/653

43/653

N

43/66

43/66

43/76

43/76

101

43/78

43/78

C

101

101

240
240

43/824		C O 7 D	231/20		Z
43/836			235/26		
C O 7 D	231/20		237/32		
	235/26		239/34		
	237/32		239/46		
	239/34		241/18		
	239/46		241/44		
	241/18		249/12	5 0 2	
	241/44		251/30		
	249/12	5 0 2	263/58		
	251/30		277/34		
	263/58		277/36		
	277/34		277/68		
	277/36		277/74		
	277/68		285/08		
	277/74	A O 1 N	43/82	1 0 1 B	
	285/08			1 0 4	
	285/13	C O 7 D	285/12	C	
(72)発明者	松本 克則	(72)発明者	熊倉 和夫		
	静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1		静岡県磐田郡豊田町森下1013番地の6		
	株式会社ケイ・アイ研究所内	(72)発明者	村松 憲通		
(72)発明者	米倉 範久		静岡県掛川市葛ヶ丘3丁目15番地の11		
	静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1	Fターム(参考)	4C031 EA03		
	株式会社ケイ・アイ研究所内		4C033 AD11 AD12 AE08 AE10 AE17		
(72)発明者	古瀬 勝美		4C036 AD05 AD08 AD19		
	静岡県小笠郡菊川町加茂1809番地		4C056 AA01 AB01 AC02 AD03 AE03		
(72)発明者	豊島 淳		AF05 CA06		
	静岡県小笠郡菊川町加茂1809番地		4H011 AA01 BA01 BB09 BB10 BC05		
			BC07 BC19 BC20 DA02 DA15		
			DA16 DD01 DD03 DD04 DH03		