

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

(11)公表番号
特表2024-528936
(P2024-528936A)

(43)公表日 令和6年8月1日(2024.8.1)

(51)国際特許分類	F I	テーマコード (参考)
C 0 7 D 401/04 (2006.01)	C 0 7 D 401/04	C S P 4 H 0 1 1
A 0 1 P 3/00 (2006.01)	A 0 1 P 3/00	
A 0 1 N 43/54 (2006.01)	A 0 1 N 43/54	G
C 0 7 D 491/107 (2006.01)	C 0 7 D 491/107	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全99頁)

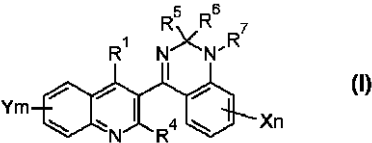
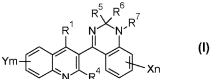
(21)出願番号	特願2024-506165(P2024-506165)	(71)出願人	508020155
(86)(22)出願日	令和4年7月25日(2022.7.25)		ビーエーエスエフ ソシエタス・ヨーロ ピア
(85)翻訳文提出日	令和6年3月12日(2024.3.12)		B A S F S E
(86)国際出願番号	PCT/EP2022/070787		ドイツ連邦共和国 6 7 0 5 6 ルードウ ィヒスハーフェン・アム・ライン カ ール・ボッシュ・ストラッセ 3 8
(87)国際公開番号	WO2023/011957		C a r l - B o s c h - S t r a s s e
(87)国際公開日	令和5年2月9日(2023.2.9)		3 8 , 6 7 0 5 6 L u d w i g s h a
(31)優先権主張番号	21189028.0		f e n a m R h e i n , G e r m a
(32)優先日	令和3年8月2日(2021.8.2)		n y
(33)優先権主張国・地域又は機関	欧州特許庁(EP)	(74)代理人	110002572
(81)指定国・地域	AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA ,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,A T,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR ,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC, 最終頁に続く		弁理士法人平木国際特許事務所
		(72)発明者	グランメノス, ヴァッシリオス
			ドイツ連邦共和国 6 7 0 5 6 ルートヴ 最終頁に続く

(54)【発明の名称】 (3-キノリル)-キナゾリン

(57)【要約】

本発明は、式 (I)

【化1】



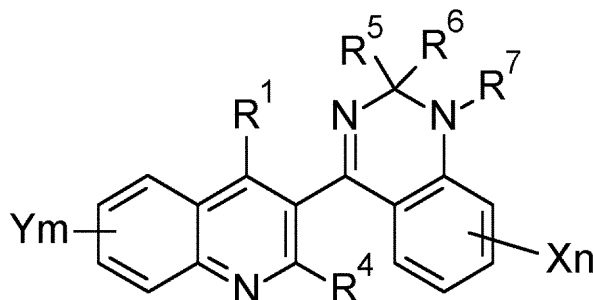
(式中、変数は、本説明及び特許請求の範囲において示
されるように定義される)
の化合物に関する。本発明は、更に、それらの使用及び
組成物に関する。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

殺真菌剤としての式 I

【化 1】



10

〔式中、

R¹ は、H、ハロゲン、CN、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロゲンアルキル；R⁴ は、H、ハロゲン、CN、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロゲンアルキルであり；R⁵ は、各場合に、ハロゲン、CN、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロゲンアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロゲンアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロゲンアルキニル、フェニル、ベンジルから独立して選択され、ここで、R⁵ のフェニル及びベンジル部分は、非置換であるか、又は1～3個の基 R^{5a} によって置換されており、それらの基は、互いに独立して、ハロゲン、CN、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロゲンアルキル、O-C₁～C₆アルキルから選択され；R⁶ は、各場合に、ハロゲン、CN、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロゲンアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロゲンアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロゲンアルキニル、フェニル、ベンジルから独立して選択され、ここで、R⁶ のフェニル及びベンジル部分は、非置換であるか、又は1～3個の基 R^{6a} によって置換されており、それらの基は、互いに独立して、ハロゲン、CN、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロゲンアルキル、O-C₁～C₆アルキルから選択されるか；

或いは

R⁵ 及び R⁶ は、それらが結合しているC原子と一緒にあって、C₃～C₆シクロアルキル又はO及びSからなる群からの1、2若しくは3個のヘテロ原子を含有する3～6員飽和複素環を形成し；

R⁷ は、各場合に、水素、CN、CH₂CN、CH(CH₃)CN、CH(=O)、C(=O)C₁～C₆アルキル、C(=O)C₂～C₆アルケニル、C(=O)C₂～C₆アルキニル、C(=O)C₃～C₆シクロアルキル、C(=O)NH-C₁～C₄アルキル、C(=O)N-(C₁～C₄アルキル)₂、C₁～C₆アルキル、C₁～C₄ハロゲンアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆ハロゲンシクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロゲンアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロゲンアルキニル、O-C₁～C₆アルキル、-S(=O)₂-R^{7a}、5若しくは6員ヘテロアリアル及びアリアル又はベンジルから独立して選択され；ここで、前記ヘテロアリアルは、N、O及びSから選択される1、2又は3個のヘテロ原子を含有し；ここで、前記アリアル及びベンジル基は、非置換であるか、又はCN、ハロゲン、OH、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロゲンアルキル、C₁～C₄アルコキシ及びC₁～C₄ハロゲンアルコキシからなる群から選択される1、2、3、4又は5個の置換基を持っており；ここで、

R^{7a} は、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロゲンアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロゲンアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロゲンアルキニル、

20

30

40

50

フェニル、ベンジルから選択され、ここで、フェニル及びベンジルは、非置換であるか、又は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルキニルによって置換されることができ；

X は、各場合に、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、 $O-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $O-C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキルから独立して選択され；

n は、0、1、2又は3であり；

Y は、各場合に、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、 $O-C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され；

m は、1、2又は3である]

の化合物並びにそのN-オキシド及び農業上許容される塩。

【請求項2】

R^5 は $C_1 \sim C_6$ アルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R^6 は、前記 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、ベンジルから選択され、ここで、 R^6 のフェニル及びベンジル部分は、非置換であるか、又は1～3個の基 R^{6a} によって置換されており、それらの基は、互いに独立して、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、 $O-C_1 \sim C_6$ アルキルから選択される、請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項4】

R^5 及び R^6 は、それらが結合している前記C原子と一緒になって $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを形成する、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項5】

X は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $O-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $O-C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキルから選択される、請求項1～4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

X は、F、 CH_3 、 C_2H_5 、 OCH_3 、 $OCHF_2$ 、 OCF_3 から選択される、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項7】

Y は、F及びClから選択される、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項8】

R^7 は、H、CN、 CH_2CN 、 $CH(CH_3)CN$ 、 $C(=O)C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C(=O)NH-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C(=O)N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) $_2$ 、 $S(=O)_2-R^{7a}$ から選択される、請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項9】

請求項1～8のいずれか一項に記載に定義されるような、式Iの1種の化合物、そのN-オキシド又は農業上許容される塩を含む、組成物。

【請求項10】

植物病原菌の駆除方法であって、前記真菌又は真菌の攻撃から保護されるべき材料、植物、土壌若しくは種子を、有効量の、請求項1～8のいずれか一項に定義されるような、式Iの少なくとも1種の化合物で又は請求項9のいずれか一項に定義されるような、組成物で処理することを含む方法。

【請求項11】

種子の100kg当たり0.1～10kgの量での、請求項1～8のいずれか一項に定義されるような、式Iの少なくとも1種の化合物若しくはその農業上許容される塩で又は請求項9のいずれか一項に定義されるような、組成物でコーティングされた、種子。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

10

20

30

40

50

本発明は、殺真菌剤としての新規なキナゾリン化合物並びにそれらのN-オキシド及び塩に並びにそれらの使用に関する。本発明は、少なくとも1種の化合物Iを含む組成物、植物病原菌を駆除する方法及び式Iの少なくとも1種の化合物でコーティングされた種子にも関する。

【背景技術】

【0002】

日本特許第2011148714号公報は、いくつかの類似の化合物を開示している。しかしながら、多くの場合に、特に低い適用率で、既知の化合物の殺真菌活性は、満足できるものではない。これに基づいて、植物病原菌に対して改善された活性及び／又はより広い活性スペクトルを有する化合物を提供することが、本発明の目的であった。本発明の別の目的は、改善された毒物学的特性を持った又は改善された環境運命特性を持った殺真菌剤を提供することである。

10

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0003】

これらの及び更なる目的は、以下に定義されるような、式(I)のキノリン化合物によって、及びそれらの農業上好適なものによって達成される。

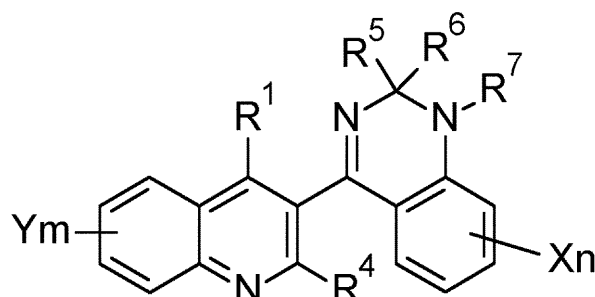
【発明を実施するための形態】

【0004】

したがって、本発明は、殺真菌剤としての、式I

20

【化1】



30

【式中、

R¹は、H、ハロゲン、CN、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロゲンアルキルであり；
R⁴は、H、ハロゲン、CN、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロゲンアルキルであり；
R⁵は、各場合に、ハロゲン、CN、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロゲンアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロゲンアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロゲンアルキニル、フェニル、ベンジルから選択され、

ここで、R⁵のフェニル及びベンジル部分は、非置換であるか、又は1～3個の基R^{5a}によって置換されており、それらの基は、互いに独立して、

ハロゲン、CN、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロゲンアルキル、O-C₁～C₆アルキルから選択され；

40

R⁶は、各場合に、ハロゲン、CN、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロゲンアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロゲンアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロゲンアルキニル、フェニル、ベンジルから選択され、

ここで、R⁶のフェニル及びベンジル部分は、非置換であるか、又は1～3個の基R^{6a}によって置換されており、それらの基は、互いに独立して、

ハロゲン、CN、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロゲンアルキル、O-C₁～C₆アルキルから選択されるか；

或いは

R⁵及びR⁶は、それらが結合しているC原子と一緒に、C₃～C₆シクロアルキル又はO及びSからなる群からの1、2若しくは3個のヘテロ原子を含有する3～6員飽

50

和複素環を形成し；

R^7 は、各場合に、水素、 CN 、 CH_2CN 、 $CH(CH_3)CN$ 、 $CH(=O)$ 、 $C(=O)C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C(=O)C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C(=O)C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C(=O)C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C(=O)NH-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C(=O)N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) $_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $O-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロゲンアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロゲンシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルキニル、 $-S(=O)_2-R^{7a}$ 、5若しくは6員ヘテロアリアル及びアリアル又はベンジルから独立して選択され；ここで、ヘテロアリアルは、 N 、 O 及び S から選択される1、2又は3個のヘテロ原子を含有し；ここで、アリアル又はベンジル基は、非置換であるか、又は CN 、ハロゲン、 OH 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロゲンアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ及び $C_1 \sim C_4$ ハロゲンアルコキシからなる群から選択される1、2、3、4又は5個の置換基を持っており；ここで、 R^{7a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルキニル、フェニル、ベンジルから選択され、ここで、フェニル及びベンジルは、非置換であるか、又はハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルキニルによって置換されることができ；

X は、各場合に、ハロゲン、 CN 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、 $O-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $O-C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキルから独立して選択され；

n は、0、1、2又は3であり；

Y は、各場合に、ハロゲン、 CN 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、 $O-C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され；

m は、1、2又は3である]

の化合物並びにそれらの N -オキシド及び農業上許容される塩に関する。

【0005】

N -オキシドは、従来の酸化法に従って、例えばメタクロロ過安息香酸（国際公開第03/64572号パンフレット又はJ. Med. Chem. 38(11), 1892-903, 1995を参照されたい）などの有機過酸で；又は過酸化水素（J. Heterocyclic Chem. 18(7), 1305-8, 1981を参照されたい）若しくはオキソン（J. Am. Chem. Soc. 123(25), 5962-5973, 2001を参照されたい）などの無機酸化剤で化合物Iを処理することによって本発明化合物から調製され得る。酸化は、純粋なモノ- N -オキシドを又は異なる N -オキシドの混合物をもたらし得、それらは、クロマトグラフィーなどの従来の方法によって分離することができる。

【0006】

式Iの化合物の農業上許容される塩は、とりわけ、それらのカチオン及びアニオンが、それぞれ、化合物Iの殺真菌作用に悪影響を及ぼさないそれらのカチオンの塩又はそれらの酸の酸付加塩を包含する。したがって、好適なカチオンは、特に、アルカリ金属、好ましくはナトリウム及びカリウムのイオン、アルカリ土類金属、好ましくはカルシウム、マグネシウム及びバリウムのイオン、遷移金属、好ましくはマンガン、銅、亜鉛及び鉄のイオン、並びにまた、必要に応じて、1～4個の $C_1 \sim C_4$ アルキルアルキル置換基及び／又は1個のフェニル若しくはベンジル置換基で置換され得るアンモニウムイオン、好ましくはジイソプロピルアンモニウム、テトラメチルアンモニウム、テトラブチルアンモニウム、トリメチルベンジルアンモニウム、更にホスホニウムイオン、スルホニウムイオン、好ましくはトリ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）スルホニウム、及びスルホキシニウムイオン、好ましくはトリ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）スルホキシニウムである。

【0007】

許容される酸付加塩のアニオンは、主にクロリド、ブロミド、フルオリド、硫酸水素、

サルフェート、リン酸二水素、リン酸水素、ホスフェート、ニトレート、重炭酸、カルボネート、ヘキサフルオロシリケート、ヘキサフルオロホスフェート、ベンゾエート、及び $C_1 \sim C_4$ アルカン酸のアニオン、好ましくはホルメート、アセテート、プロピオネート及びブチレートである。それらは、化合物 I を、対応するアニオンの酸、好ましくは塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸又は硝酸と反応させることによって形成することができる。

【0008】

式 I の化合物は、1 つ又は複数の立体異性体として存在することができる。様々な立体異性体には、エナンチオマー、ジアステレオマー、非対称基の単結合回りの制限された回転から生じるアトロプ異性体及び幾何異性体が含まれる。それらはまた、本発明の主題の一部を形成する。当業者は、1 つの立体異性体が、他の立体異性体に対して濃縮された場合に又は他の立体異性体から分離された場合に、より活性であり得る及び／又は有益な効果を示し得ることを十分理解するであろう。更に、当業者は、前記立体異性体を分離する、濃縮する、及び／又は選択的に調製する方法を知っている。本発明の化合物は、立体異性体の混合物、例えばラセミ体、個々の立体異性体として、又は光学活性体として存在し得る。

10

【0009】

式 I の化合物は、その生物学的活性が異なり得る異なる結晶変態で存在することができる。それらはまた、本発明の主題の一部を形成する。

【0010】

変数に関して、化合物 I の調製中に得られる中間体の実施形態は、式 I の化合物の実施形態に対応する。「化合物 I」という用語は、式 I の化合物を言う。

20

【0011】

以下で、中間化合物が更に説明される。当業者は、置換基についての好ましさ、特に、化合物 I に関連して本明細書で示される、それぞれの置換基について以下の表で示される置換基の好ましさも、それに応じて中間体に適用されることを容易に理解するであろう。それにより、各場合における置換基は、互いに独立して又はより好ましくは組み合わせて、本明細書で定義されるような意味を有する。

【0012】

合成が異性体の混合物をもたらす場合に、場合によっては、個々の異性体が、使用するための仕上げ中に又は適用中（例えば光、酸又は塩基の作用下）に相互変換することができるので、分離は、一般に、必ずしも必要ではない。そのような変換はまた、使用後に、例えば処理された植物中の植物の処理において、又は防除される有害な真菌において起こり得る。

30

【0013】

上記の変数の定義では、対象の置換基を一般に代表する総称が用いられる。「 $C_n \sim C_m$ 」という用語は、対象の置換基又は置換基部分において、各場合に可能な炭素原子数を示す。

【0014】

「ハロゲン」という用語は、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素を言う。

【0015】

「 $C_1 \sim C_6$ アルキル」という用語は、1 ～ 6 個の炭素原子を有する直鎖又は分枝飽和炭化水素基、例えばメチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル、1, 1-ジメチルエチル、ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2, 2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、1, 1-ジメチルプロピル、1, 2-ジメチルプロピル、ヘキシル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1, 1-ジメチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、3, 3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1, 1, 2-トリメチルプロピル、1, 2, 2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル及び1-エチル-2-メチルプロピルを言う。同様に、「 $C_2 \sim C$

40

50

「4 アルキル」という用語は、2～4 個の炭素原子を有する直鎖又は分枝アルキル基、例えばエチル、プロピル（*n*-プロピル）、1-メチルエチル（イソプロピル）、ブチル、1-メチルプロピル（*sec.*-ブチル）、2-メチルプロピル（イソブチル）、1, 1-ジメチルエチル（*tert.*-ブチル）を言う。

【0016】

「 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル」という用語は、これらの基中の水素原子の一部又は全部が、上述のようなハロゲン原子に置き換えられ得る、上で定義されたような1又は6 個の炭素原子を有するアルキル基を言う。例は、「 $C_1 \sim C_2$ ハロゲンアルキル」基、例えばクロロメチル、ブromoメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、1-クロロエチル、1-ブromoエチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル又はペンタフルオロエチルなどである。

10

【0017】

「 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ」という用語は、アルキル基における任意の位置において、酸素を介して結合している1～6 個の炭素原子を有する直鎖又は分枝アルキル基を言う。例は、「 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ」基、例えばメトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、1-メチルエトキシ、ブトキシ、1-メチルプロポキシ、2-メチルプロポキシ又は1, 1-ジメチルエトキシなどである。

20

【0018】

「 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルコキシ」という用語は、これらの基中の水素原子の一部又は全部が、上述のようなハロゲン原子に置き換えられ得る、上で定義されたような $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基を言う。例は、「 $C_1 \sim C_4$ ハロゲンアルコキシ」基、例えば OCH_2F 、 $OCHF_2$ 、 OCF_3 、 OCH_2Cl 、 $OCHCl_2$ 、 $OCCL_3$ 、クロロフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブromoエトキシ、2-ヨードエトキシ、2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2-フルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエトキシ、2, 2, 2-トリクロロエトキシ、 OC_2F_5 、2-フルオロプロポキシ、3-フルオロプロポキシ、2, 2-ジフルオロプロポキシ、2, 3-ジフルオロプロポキシ、2-クロロプロポキシ、3-クロロプロポキシ、2, 3-ジクロロプロポキシ、2-ブromoプロポキシ、3-ブromoプロポキシ、3, 3, 3-トリフルオロプロポキシ、3, 3, 3-トリクロロプロポキシ、 $OCH_2-C_2F_5$ 、 $OCF_2-C_2F_5$ 、1-フルオロメチル-2-フルオロエトキシ、1-クロロメチル-2-クロロエトキシ、1-ブromoメチル-2-ブromoエトキシ、4-フルオロブトキシ、4-クロロブトキシ、4-ブromoブトキシ又はノナフルオロブトキシなどである。

30

【0019】

「 $C_2 \sim C_6$ アルケニル」という用語は、2～6 個の炭素原子及び任意の位置に二重結合を有する直鎖又は分枝不飽和炭化水素基を言う。例は、「 $C_2 \sim C_4$ アルケニル」基、例えばエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル（アリル）、1-メチルエテニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニルなどである。

40

【0020】

「 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルケニル」という用語は、これらの基中の水素原子の一部又は全部が、上述のようなハロゲン原子に置き換えられ得る、上で定義されたような2又は6 個の炭素原子を有するアルキル基を言う。

【0021】

50

「 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ」という用語は、アルケニル基の任意の位置において、酸素を介して結合している2～6個の炭素原子を有する直鎖又は分枝アルケニル基を言う。例は、「 $C_2 \sim C_4$ アルケニルオキシ」基である。

【0022】

「 $C_2 \sim C_6$ アルキニル」という用語は、2～6個の炭素原子を有し、及び少なくとも1個の三重結合を含有する直鎖又は分枝不飽和炭化水素基を言う。例は、「 $C_2 \sim C_4$ アルキニル」基、例えばエチニル、プロプ-1-イニル、プロプ-2-イニル（プロパルギル）、ブト-1-イニル、ブト-2-イニル、ブト-3-イニル、1-メチルプロプ-2-イニルなどである。

【0023】

「 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルキニル」という用語は、これらの基中の水素原子の一部又は全部が、上述のようなハロゲン原子に置き換えられ得る、上で定義されたような2又は6個の炭素原子を有するアルキル基を言う。

【0024】

「 $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ」という用語は、アルキニル基の任意の位置において、酸素を介して結合している2～6個の炭素原子を有する直鎖又は分枝アルキニル基を言う。例は、「 $C_2 \sim C_4$ アルキニルオキシ」基である。

【0025】

「 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル」という用語は、3～6個の炭素環員を有する単環式飽和炭化水素基、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルなどを言う。したがって、飽和の3、4、5、6、7、8、9又は10員カルボシクリル又は炭素環は、「 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル」である。

【0026】

「 $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニル」という用語は、3～6個の炭素環員及び少なくとも1個の二重結合を有する単環式部分不飽和の3、4、5又は6員炭素環、例えばシクロペンテニル、シクロペンタジエニル、シクロヘキサジエニルなどを言う。したがって、部分不飽和の3、4、5、6、7、8、9又は10員カルボシクリル又は炭素環は、「 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルケニル」である。

【0027】

「 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ アルキル」という用語は、アルキル基の1個の水素原子が、（上で定義されたような）3～8個の炭素原子を有するシクロアルキル基に置き換えられている、（上で定義されたような）1～4個の炭素原子を有するアルキルを言う。

【0028】

「ヘテロシクリル又は複素環が、N、O及びSから選択される1、2、3又は4個のヘテロ原子を含有する、飽和又は部分不飽和3、4、5、6、7、8、9又は10員ヘテロシクリル又は複素環」という用語は、飽和及び部分不飽和複素環の両方を意味すると理解されるべきであり、ここで、複素環の環員原子は、炭素原子に加えて、O、N及びSの群から独立して選択される1、2、3又は4個のヘテロ原子を含む。例えば：

環員としてO、N及びSからなる群からの1又は2個のヘテロ原子を含有する3又は4員飽和複素環、例えばオキシラン、アジリジン、チラン、オキセタン、アゼチジン、チエタン、[1, 2] ジオキセタン、[1, 2] ジチエタン、[1, 2] ジアゼチジンなど；並びに

環員としてO、N及びSからなる群からの1、2又は3個のヘテロ原子を含有する5又は6員飽和又は部分不飽和複素環、例えば2-テトラヒドロフラニル、3-テトラヒドロフラニル、2-テトラヒドロチエニル、3-テトラヒドロチエニル、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル、3-イソキサゾリジニル、4-イソキサゾリジニル、5-イソキサゾリジニル、3-イソチアゾリジニル、4-イソチアゾリジニル、5-イソチアゾリジニル、3-ピラゾリジニル、4-ピラゾリジニル、5-ピラゾリジニル、2-オキサゾリジニル、4-オキサゾリジニル、5-オキサゾリジニル、2-チアゾリジニル、4-チアゾリジニル、

10

20

30

40

50

ニル、5-チアゾリジニル、2-イミダゾリジニル、4-イミダゾリジニル、1, 2, 4-オキサジアゾリジン-3-イル、1, 2, 4-オキサジアゾリジン-5-イル、1, 2, 4-チアジアゾリジン-3-イル、1, 2, 4-チアジアゾリジン-5-イル、1, 2, 4-トリアゾリジン-3-イル、1, 3, 4-オキサジアゾリジン-2-イル、1, 3, 4-チアジアゾリジン-2-イル、1, 3, 4-トリアゾリジン-2-イル、2, 3-ジヒドロフル-2-イル、2, 3-ジヒドロフル-3-イル、2, 4-ジヒドロフル-2-イル、2, 4-ジヒドロフル-3-イル、2, 3-ジヒドロチエン-2-イル、2, 3-ジヒドロチエン-3-イル、2, 4-ジヒドロチエン-2-イル、2, 4-ジヒドロチエン-3-イル、2-ピロリン-2-イル、2-ピロリン-3-イル、3-ピロリン-2-イル、3-ピロリン-3-イル、2-イソキサゾリン-3-イル、3-イソキサゾリン-3-イル、4-イソキサゾリン-3-イル、2-イソキサゾリン-4-イル、3-イソキサゾリン-4-イル、4-イソキサゾリン-4-イル、2-イソキサゾリン-5-イル、3-イソキサゾリン-5-イル、4-イソキサゾリン-5-イル、2-イソチアゾリン-3-イル、3-イソチアゾリン-3-イル、4-イソチアゾリン-3-イル、2-イソチアゾリン-4-イル、3-イソチアゾリン-4-イル、4-イソチアゾリン-4-イル、2-イソチアゾリン-5-イル、3-イソチアゾリン-5-イル、4-イソチアゾリン-5-イル、2, 3-ジヒドロピラゾル-1-イル、2, 3-ジヒドロピラゾル-2-イル、2, 3-ジヒドロピラゾル-3-イル、2, 3-ジヒドロピラゾル-4-イル、2, 3-ジヒドロピラゾル-5-イル、3, 4-ジヒドロピラゾル-1-イル、3, 4-ジヒドロピラゾル-3-イル、3, 4-ジヒドロピラゾル-4-イル、3, 4-ジヒドロピラゾル-5-イル、4, 5-ジヒドロピラゾル-1-イル、4, 5-ジヒドロピラゾル-3-イル、4, 5-ジヒドロピラゾル-4-イル、4, 5-ジヒドロピラゾル-5-イル、2, 3-ジヒドロオキサゾル-2-イル、2, 3-ジヒドロオキサゾル-3-イル、2, 3-ジヒドロオキサゾル-4-イル、2, 3-ジヒドロオキサゾル-5-イル、3, 4-ジヒドロオキサゾル-2-イル、3, 4-ジヒドロオキサゾル-3-イル、3, 4-ジヒドロオキサゾル-4-イル、3, 4-ジヒドロオキサゾル-5-イル、3, 4-ジヒドロオキサゾル-2-イル、3, 4-ジヒドロオキサゾル-3-イル、3, 4-ジヒドロオキサゾル-4-イル、2-ペリジニル、3-ペリジニル、4-ペリジニル、1, 3-ジオキサン-5-イル、2-テトラヒドロピラニル、4-テトラヒドロピラニル、2-テトラヒドロチエニル、3-ヘキサヒドロピリダジニル、4-ヘキサヒドロピリダジニル、2-ヘキサヒドロピリミジニル、4-ヘキサヒドロピリミジニル、5-ヘキサヒドロピリミジニル、2-ペラジニル、1, 3, 5-ヘキサヒドロトリアジン-2-イル及び1, 2, 4-ヘキサヒドロトリアジン-3-イル並びにまた対応する-イリデン基など；並びに

7員飽和又は部分不飽和複素環、例えばテトラ-及びヘキサヒドロアゼピニル、例えば2, 3, 4, 5-テトラヒドロ[1H]アゼピン-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-若しくは-7-イル、3, 4, 5, 6-テトラヒドロ[2H]アゼピン-2-, -3-, -4-, -5-, -6-若しくは-7-イル、2, 3, 4, 7-テトラヒドロ[1H]アゼピン-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-若しくは-7-イル、2, 3, 6, 7-テトラヒドロ[1H]アゼピン-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-若しくは-7-イル、ヘキサヒドロアゼピン-1-, -2-, -3-若しくは-4-イル、テトラ-及びヘキサヒドロオキセピニル、例えば2, 3, 4, 5-テトラヒドロ[1H]オキセピン-2-, -3-, -4-, -5-, -6-若しくは-7-イル、2, 3, 4, 7-テトラヒドロ[1H]オキセピン-2-, -3-, -4-, -5-, -6-若しくは-7-イル、2, 3, 6, 7-テトラヒドロ[1H]オキセピン-2-, -3-, -4-, -5-, -6-若しくは-7-イル、ヘキサヒドロアゼピン-1-, -2-, -3-若しくは-4-イル、テトラ-及びヘキサヒドロ-1, 3-ジアゼピニル、テトラ-及びヘキサヒドロ-1, 4-ジアゼピニル、テトラ-及びヘキサヒドロ-1, 3-オキサゼピニル、テトラ-及びヘキサヒドロ-1, 4-オキサゼピニル、テトラ-及びヘキサヒドロ-1, 3-ジオキセピニル、テトラ-及びヘキサヒドロ-1, 4-ジオキセピ

10

20

30

40

50

ニル並びに対応する－イリデン基など。

【0029】

「置換されている」という用語は、1、2、3又は可能な最大数までの置換基で置換されていることを言う。

【0030】

「5若しくは6員ヘテロアリール」又は「5若しくは6員ヘテロ芳香族」という用語は、炭素原子に加えて、N、O及びSからなる群から独立して選択される1、2、3又は4個のヘテロ原子を含む芳香族環系、例えば、

5員ヘテロアリール、例えばピロール-1-イル、ピロール-2-イル、ピロール-3-イル、チエン-2-イル、チエン-3-イル、フラン-2-イル、フラン-3-イル、ピラゾール-1-イル、ピラゾール-3-イル、ピラゾール-4-イル、ピラゾール-5-イル、イミダゾール-1-イル、イミダゾール-2-イル、イミダゾール-4-イル、イミダゾール-5-イル、オキサゾール-2-イル、オキサゾール-4-イル、オキサゾール-5-イル、イソオキサゾール-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、イソオキサゾール-5-イル、チアゾール-2-イル、チアゾール-4-イル、チアゾール-5-イル、イソチアゾール-3-イル、イソチアゾール-4-イル、イソチアゾール-5-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、1,2,4-トリアゾール-3-イル、1,2,4-トリアゾール-5-イル、1,2,4-オキサジアゾール-3-イル、1,2,4-オキサジアゾール-5-イル及び1,2,4-チアジアゾール-3-イル、1,2,4-チアジアゾール-5-イルなど；又は

6員ヘテロアリール、例えばピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、ピリダジン-3-イル、ピリダジン-4-イル、ピリミジン-2-イル、ピリミジン-4-イル、ピリミジン-5-イル、ピラジン-2-イル及び1,3,5-トリアジン-2-イル及び1,2,4-トリアジン-3-イルなど

を言う。

【0031】

以下では、本発明化合物の特定の実施形態が説明される。そこでは、それぞれの置換基の具体的な意味が更に詳述され、ここで、それらの意味は、各場合に、それら自体で、しかし互いに任意の組合せでも、本発明の特定の実施形態である。

【0032】

更に、変数に関して、一般に、化合物Iの実施形態は、中間体にも適用される。

【0033】

式Iの化合物の一実施形態によれば、 R^1 は、H、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロゲンアルキルである。

【0034】

式Iの化合物の一実施形態によれば、 R^1 はHである。

【0035】

式Iの化合物の一実施形態によれば、 R^1 は CH_3 である。

【0036】

式Iの化合物の一実施形態によれば、 R^4 は、H、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロゲンアルキルである。

【0037】

式Iの化合物の一実施形態によれば、 R^4 はHである。

【0038】

式Iの化合物の一実施形態によれば、 R^4 は CH_3 である。

【0039】

R^5 は、各場合に、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル-O- $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、ベンジルから独立して選択され、

ここで、 R^5 のフェニル及びベンジル部分は、非置換であるか、又は1～3個の基 R^{5a} によって置換されており、それらの基は、互いに独立して、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、 $O-C_1 \sim C_6$ アルキルから選択される。

【0040】

式Iの化合物の一実施形態によれば、 R^5 は、各場合に、 $C_1 \sim C_6$ アルキル（実施形態5.1）、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル（実施形態5.2）、 $C_1 \sim C_6$ アルキル- $O-C_1 \sim C_6$ アルキル（実施形態5.3）、フェニル、 CH_2 -フェニル（実施形態5.4）、ハロゲン（実施形態5.5）から独立して選択され、ここで、フェニル及び CH_2 -フェニルは、非置換であるか、又は1若しくは2個のハロゲンによって置換されている。

10

【0041】

式Iの化合物の更なる一実施形態によれば、 R^5 は、 CH_3 又は CF_3 である。

【0042】

式Iの化合物の更なる一実施形態によれば、 R^5 は、 CH_2CH_3 、 $CH(CH_3)_2$ 、 $CH(CH_3)CH_2CH_3$ 、 $C(CH_3)_3$ 、 $CH_2-CH(CH_3)_2$ 、 $CH_2-C(CH_3)_3$ 、 CH_2-O-CH_3 である。

【0043】

式Iの化合物の更なる一実施形態によれば、 R^5 は、フェニル、2-F-フェニル、4-F-フェニル、2,4-F₂-フェニル、2-Cl-フェニル、4-Cl-フェニル、 CH_2 -フェニル、 CH_2 -2-F-フェニル、 CH_2 -4-F-フェニルである。

20

【0044】

式Iの化合物の一実施形態によれば、 R^6 は、各場合に、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル- $O-C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、ベンジル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル- O -フェニルから独立して選択され、各場合にそれらから独立して選択され、

ここで、 R^6 のフェニル及びベンジル部分は、非置換であるか、又は1～3個の基 R^{6a} によって置換されており、それらの基は、互いに独立して、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、 $O-C_1 \sim C_6$ アルキルから選択される。

30

【0045】

式Iの化合物の一実施形態によれば、 R^6 は、各場合に、 $C_1 \sim C_6$ アルキル（実施形態6.1）、 $C_1 \sim C_6$ アルキル- O -フェニル（実施形態6.2）、 $C_1 \sim C_6$ アルキル- $O-C_1 \sim C_6$ アルキル（実施形態6.3）ハロゲン（実施形態6.4）から独立して選択される。

【0046】

式Iの化合物の更なる一実施形態によれば、 R^6 は、 CH_3 又は CF_3 である。

【0047】

式Iの化合物の更なる一実施形態によれば、 R^6 は、 CH_2CH_3 、 $CH(CH_3)_2$ 、 $CH(CH_3)CH_2CH_3$ 、 $C(CH_3)_3$ 、 $CH_2-CH(CH_3)_2$ 、 $CH_2-C(CH_3)_3$ 、 $CH_2-CH(CH_3)-C(CH_3)_3$ 、 $CH_2-CH_2-C(CH_3)_3$ 、 CH_2-O-CH_3 、 $CH_2-O-(CH_3)_3$ 、 CH_2-O -フェニルである。

40

【0048】

式Iの化合物の更なる一実施形態によれば、 R^5 及び R^6 は、それらが結合しているC原子と一緒に、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル又はO及びSからなる群からの1、2若しくは3個のヘテロ原子を含有する3～6員飽和複素環を形成する。

【0049】

式Iの化合物の更なる一実施形態によれば、 R^5 及び R^6 は、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル（実施形態6.5）を形成する。

50

【0050】

式 I の化合物の更なる一実施形態によれば、 R^5 及び R^6 は、O 及び S からなる群からの 1、2 又は 3 個のヘテロ原子を含有する 3～6 員飽和複素環を形成する。

【0051】

式 I の化合物の更なる一実施形態によれば、 R^5 及び R^6 は、1 個の O を含有する 3～6 員飽和複素環（実施形態 6.6）を形成する。

【0052】

本発明による R^5 、 R^6 の好ましい実施形態は、以下の表 P5 にあり、ここで、行 P5-1～P5-18 の各行は、本発明の特定の一実施形態に対応し、ここで、P5-1～P5-18 はまた、互いに任意の組合せで本発明の好ましい実施形態である。 R^5 及び R^6 が結合している、炭素原子への接続点は、図面において「#」を付けられている。

10

【0053】

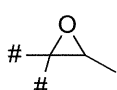
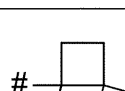
20

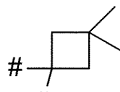
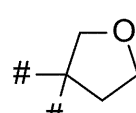
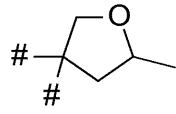
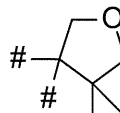
30

40

50

【表 1】
表 P5,6:

No.	R ⁵	R ⁶
P5-1		
P5-2		
P5-3		
P5-4		
P5-5		
P5-6		
P5-7		
P5-8		
P5-9		
P5-10		

No.	R ⁵	R ⁶
P5-11		
P5-12		
P5-13		
P5-14		
P5-15		
P5-16		
P5-17		
P5-18		

10

20

30

40

【0054】

R⁷ は、各場合に、水素、CN、CH₂CN、CH(CH₃)CN、CH(=O)、C(=O)C₁~C₆アルキル、C(=O)C₂~C₆アルケニル、C(=O)C₂~C₆アルキニル、C(=O)C₃~C₆シクロアルキル、C(=O)NH-C₁~C₄アルキル、C(=O)N-(C₁~C₄アルキル)₂、C₁~C₆アルキル、O-C₁~C₆アルキル、C₁~C₄ハロゲンアルキル、C₃~C₆シクロアルキル、C₃~C₆ハロゲンシクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆ハロゲンアルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₂~C₆ハロゲンアルキニル、CH₂C(=O)C₂~C₆アルケニル、CH₂C(=O)C₂~C₆アルキニル、CH₂C(=O)C₃~C₆シクロアルキル、C

50

$\text{H}_2\text{C}(\text{=O})\text{NH}-\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル、 $\text{CH}_2\text{C}(\text{=O})\text{N}-(\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル) $_2$ 、 $-\text{S}(\text{=O})_2-\text{R}^{7a}$ 、5 若しくは 6 員ヘテロアリアル及びアリアルから独立して選択され；ここで、ヘテロアリアルは、N、O 及び S から選択される 1、2 又は 3 個のヘテロ原子を含有し；ここで、アリアル基は、非置換であるか、又は CN 、ハロゲン、O、H、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロゲンアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルコキシ及び $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ ハロゲンアルコキシからなる群から選択される 1、2、3、4 又は 5 個の置換基を持っており；ここで、

R^{7a} は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロゲンアルキル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ ハロゲンアルケニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ ハロゲンアルキニル、フェニル、ベンジルから選択され、ここで、フェニル及びベンジルは、非置換であるか、又は、ハロゲン、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロゲンアルキル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ ハロゲンアルケニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ ハロゲンアルキニルによって置換されることができる。

10

【0055】

式 I の一実施形態によれば、 R^7 は H である。

【0056】

式 I の更に別の実施形態によれば、 R_7 は、Cl、F である。

【0057】

式 I の更に別の実施形態によれば、 R^7 は、 CN 、 CH_2CN 又は $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CN}$ である。

20

【0058】

式 I の更なる具体的な実施形態によれば、 R^7 は $\text{CH}(\text{=O})$ である。

【0059】

式 I の更なる具体的な実施形態によれば、 R^7 は OCH_3 である。

【0060】

式 I の更なる具体的な実施形態によれば、 R^7 は $\text{C}(\text{=O})\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルであり、ここで、アルキルは、 CH_3 、 C_2H_5 、 n -プロピル、 i -プロピル、 n -ブチル、 i -ブチル、 tert -ブチル、 n -ペンチル又は i -ペンチルである。

【0061】

式 I の更なる具体的な実施形態によれば、 R^7 は $\text{C}(\text{=O})\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニルであり、ここで、アルケニルは、 $\text{CH}=\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ である。

30

【0062】

式 I の更なる具体的な実施形態によれば、 R^7 は $\text{C}(\text{=O})\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキニルであり、ここで、アルキニルは、 $\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ である。

【0063】

式 I の更なる具体的な実施形態によれば、 R^7 は $\text{C}(\text{=O})\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキルであり、ここで、シクロアルキルは、シクロプロピル (C_3H_7) 又はシクロブチル (C_4H_9) である。

【0064】

式 I の更なる具体的な実施形態によれば、 R^7 は、 $\text{C}(\text{=O})\text{NH}-\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル又は $\text{C}(\text{=O})\text{N}-(\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル) $_2$ であり、ここで、アルキルは、 CH_3 、 C_2H_5 、 n -プロピル、 i -プロピル、 n -ブチル、 i -ブチル、 tert -ブチルである。

40

【0065】

式 I の更に別の実施形態によれば、 R^7 は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、例えば CH_3 、 C_2H_5 、 n -プロピル、 i -プロピル、 n -ブチル、 i -ブチル、 tert -ブチル、 n -ペンチル又は i -ペンチルなどである。

【0066】

式 I の更に別の実施形態によれば、 R^7 は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、特に $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル、例えば CH_3 、 C_2H_5 、 n -プロピル、 i -プロピルなどである。

50

【0067】

式Iの更に別の実施形態によれば、 R^7 は、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、特に $C_1 \sim C_4$ ハロゲンアルキル、例えば CF_3 、 CCl_3 、 FCH_2 、 $ClCH_2$ 、 F_2CH 、 Cl_2CH 、 CF_3CH_2 、 CCl_3CH_2 又は CF_2CHF_2 などである。

【0068】

式Iの更に別の実施形態によれば、 R^7 は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、特にシクロプロピルである。

【0069】

式Iの更に別の実施形態によれば、 R^7 は $C_3 \sim C_6$ ハロゲンシクロアルキルである。特別な実施形態において、 R^{5b} は、完全若しくは部分ハロゲン化シクロプロピル、例えば1-Fシクロプロピル、1-Clシクロプロピル、1, 1-F₂シクロプロピル、1, 1-Cl₂シクロプロピルなどである。

10

【0070】

式Iのもっと更なる実施形態によれば、 R^7 は、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、特に $C_2 \sim C_4$ アルケニル、例えば $CH=CH_2$ 、 $C(CH_3)=CH_2$ 、 $CH_2CH=CH_2$ などである。

【0071】

式Iの更なる具体的な実施形態によれば、 R^7 は、 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルケニル、特に $C_2 \sim C_4$ ハロゲンアルケニル、より特に $C_2 \sim C_3$ ハロゲンアルケニル、例えば $CH=CHF$ 、 $CH=CHCl$ 、 $CH=CF_2$ 、 $CH=CCl_2$ 、 $CH_2CH=CHF$ 、 $CH_2CH=CHCl$ 、 $CH_2CH=CF_2$ 、 $CH_2CH=CCl_2$ 、 $CF_2CH=CF_2$ 、 $CCl_2CH=CCl_2$ 、 $CF_2CF=CF_2$ 、 $CCl_2CCl=CCl_2$ などである。

20

【0072】

式Iのもっと更なる実施形態によれば、 R^7 は、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル又は $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルキニル、特に $C_2 \sim C_4$ アルキニル又は $C_2 \sim C_4$ ハロゲンアルキニル、例えば $C \equiv CH$ 、 $CH_2C \equiv CH$ などである。

【0073】

式Iのもっと更なる実施形態によれば、 R^7 は $-S(=O)_2-R^{7a}$ であり、ここで、 R^{7a} は、好ましくは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、特に $C_1 \sim C_4$ アルキル、例えば CH_3 、 C_2H_5 、 n -プロピル、 i -プロピルなどである。

30

【0074】

式Iの更に別の実施形態によれば、 R^7 は、アリール、特にフェニルであり、ここで、アリール又はフェニル部分は、各場合に、非置換であるか、又は同一の若しくは異なる基 R^{5b} によって置換されており、それらの基は、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロゲンアルキル及び $C_1 \sim C_2$ ハロゲンアルコキシ、特にF、Cl、Br、 CH_3 、 OCH_3 、 CF_3 及び OCF_3 から選択される。一実施形態によれば、 R^5 は非置換フェニルである。別の実施形態によれば、 R^5 は、特にF、Cl及びBrから選択される、より特にF及びClから選択される、1、2又は3個、特に1個のハロゲンによって置換されている、フェニルである。

【0075】

40

式Iの更に別の実施形態によれば、 R^7 は、5員ヘテロアリール、例えばピロール-1-イル、ピロール-2-イル、ピロール-3-イル、チエン-2-イル、チエン-3-イル、フラン-2-イル、フラン-3-イル、ピラゾール-1-イル、ピラゾール-3-イル、ピラゾール-4-イル、ピラゾール-5-イル、イミダゾール-1-イル、イミダゾール-2-イル、イミダゾール-4-イル、イミダゾール-5-イル、オキサゾール-2-イル、オキサゾール-4-イル、オキサゾール-5-イル、イソオキサゾール-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、イソオキサゾール-5-イル、チアゾール-2-イル、チアゾール-4-イル、チアゾール-5-イル、イソチアゾール-3-イル、イソチアゾール-4-イル、イソチアゾール-5-イル、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル、1, 2, 4-トリアゾール-3-イル、1, 2, 4-トリアゾール-5-イル、1, 2, 4-オ

50

キサジアゾール-3-イル、1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル及び1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル、1, 2, 4-チアジアゾール-5-イルなどである。

【0076】

式Iの更に別の実施形態によれば、 R^7 は、6員ヘテロアリール、例えばピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、ピリダジン-3-イル、ピリダジン-4-イル、ピリミジン-2-イル、ピリミジン-4-イル、ピリミジン-5-イル、ピラジン-2-イル及び1, 3, 5-トリアジン-2-イル及び1, 2, 4-トリアジン-3-イルなどである。

【0077】

式Iの更に別の実施形態によれば、 R^7 は、各場合に、H、ハロゲン、OH、CN、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ及び $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、 R^5 の非環式部分は、非置換であるか、又は定義されるような、好ましくは本明細書で定義されるような同一の若しくは異なる基 R^{5a} で置換されており、ここで、 R^5 の炭素環、フェニル及びヘテロアリール部分は、非置換であるか、又は定義されるような、好ましくは本明細書で定義されるような同一の若しくは異なる基 R^{5b} で置換されている。

10

【0078】

本発明による R^7 の特に好ましい実施形態は、以下の表P7にあり、ここで、行P7-1~P7-33の各行は、本発明の特定の一実施形態に対応し、ここで、P7-1~P7-33はまた、互いに任意の組合せで本発明の好ましい実施形態である。 R^7 が結合している、炭素原子への接続点は、図面において「#」を付けられている。

20

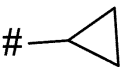
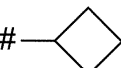
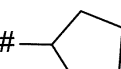
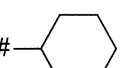
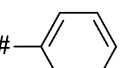
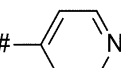
【0079】

30

40

50

【表 2】
表 P5:

No.	R ⁵	No.	R ⁵
P7-1	H	P7-20	CH ₂ CN
P7-2	CH ₃	P7-21	CH(CH ₃)CN
P7-3	CH ₂ F	P7-22	CH(=O)
P7-4	CHF ₂	P7-23	C(=O)CH ₃
P7-5	CF ₃	P7-24	C(=O)NH-CH ₃
P7-6	C ₂ H ₅	P7-25	C(=O)N(CH ₃) ₂
P7-7	C ₃ H ₇	P7-26	S(=O) ₂ -CH ₃
P7-8	CH(CH ₃) ₂	P7-27	# 
P7-9	CH ₂ CH ₂ CH ₃	P7-28	# 
P7-10	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	P7-29	# 
P7-11	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	P7-30	# 
P7-12	C(CH ₃) ₃	P7-31	# 
P7-13	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	P7-32	# 
P7-14	CH=CH ₂	P7-33	OCH ₃
P7-15	CH ₂ CH=CH ₂		
P7-16	C≡CH		
P7-17	CH ₂ C≡CH		
P7-18	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂		
P7-19	CN		

【0080】
式Ⅰの化合物の一実施形態によれば、Xは、各場合に、ハロゲン（実施形態X．1）、CN、C₁～C₆アルキル（実施形態X．2）、C₁～C₆ハロゲンアルキル（実施形態X．3）、O-C₁～C₆アルキル（実施形態X．4）、O-C₁～C₆ハロゲンアルキル（実施形態X．5）から独立して選択される。

【0081】
式Ⅰの化合物の一実施形態によれば、Xは、各場合に、ハロゲン、O-C₁～C₆アルキルから独立して選択される。

【0082】

10

20

30

40

50

式 I の化合物の一実施形態によれば、X は、各場合に、F 又は C₁ から独立して選択される。

【0083】

式 I の化合物の一実施形態によれば、n は 0 である。

【0084】

式 I の化合物の一実施形態によれば、n は 1 である。

【0085】

式 I の化合物の一実施形態によれば、n は 2 である。

【0086】

式 I の化合物の一実施形態によれば、Y は H である。

10

【0087】

式 I の化合物の一実施形態（実施形態 Y. 1）によれば、Y は、各場合に、ハロゲン、CN、C₁～C₆ アルキル、C₁～C₆ ハロゲンアルキル、O-C₁～C₆ アルキルから独立して選択される。

【0088】

式 I の化合物の一実施形態（実施形態 Y. 2）によれば、Y は、各場合に、ハロゲンから独立して選択される。

【0089】

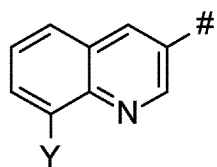
式 I の化合物の一実施形態（実施形態 Y. 3）によれば、Y は、各場合に、F 又は C₁ から独立して選択される。

20

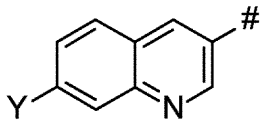
【0090】

式 I の化合物の一実施形態（実施形態 Y. 4）によれば、Y は、部分式（y. 1～y. 10）において定義される。

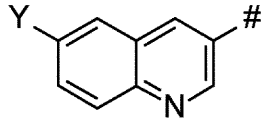
【化 2】



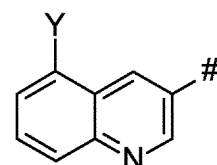
y.1



y.2

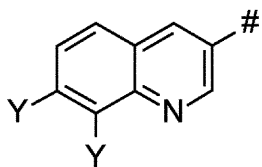


y.3

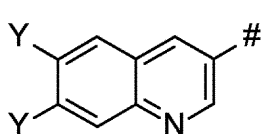


y.4

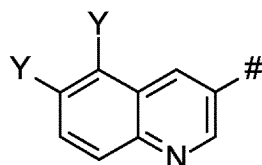
30



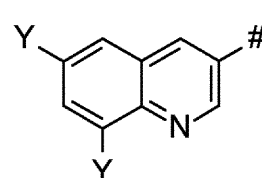
y.5



y.6

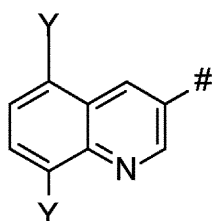


y.7

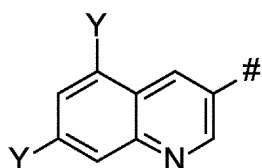


y.8

40



y.9



y.10

【0091】

式 I の化合物の一実施形態によれば、m は 1 である。

50

【0092】

式 I の化合物の一実施形態によれば、 m は 2 である。

【0093】

一実施形態において、本発明は、式 I の化合物、又はそれらの N-オキシド、又は農業上許容される塩であって、

R^1 は H であり；

R^4 は H であり；

R^5 は、各場合に、ハロゲン、CN、 $C_2 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル-O- $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、ベンジルから独立して選択され；

ここで、 R^5 のフェニル及びベンジル部分は、非置換であるか、又は 1～3 個の基 R^{5a} によって置換されており、それらの基は、互いに独立して、

ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、O- $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択され；

R^6 は、各場合に、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロゲンアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル-O- $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、ベンジル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル-O-フェニルから独立して選択され；

ここで、 R^6 のフェニル及びベンジル部分は、非置換であるか、又は 1～3 個の基 R^{6a} によって置換されており、それらの基は、互いに独立して、

ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、O- $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択されるか；

或いは

R^5 及び R^6 は、それらが結合している C 原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル又は O 及び S からなる群からの 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子を含有する 3～6 員飽和複素環を形成し；

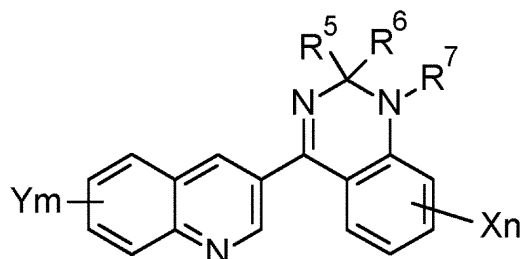
X は、各場合に、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、O- $C_1 \sim C_6$ アルキル、O- $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキルから独立して選択され；

n は、0、1、2 又は 3 であり；

Y は、各場合に、ハロゲン、CN、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲンアルキル、O- $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され、

m は、1、2 又は 3 である。

【化 3】



【0094】

更なる態様において、本発明は、以下に定義されるような式 I の化合物において、変数 Y（実施形態 Y. 1～Y. 4 及び y. 1～y. 10 で表される）、及び X（実施形態 X. 1～X. 6 で表される）、 n のそれぞれについて上で定義される実施形態の好ましい組合せを表す、表 E に列挙される実施形態 E. 1～E. 280 に関する。

【0095】

10

20

30

40

50

【表 3】

表 E:

実施形態	X	n	Y
E.1	(X.1)	0, 1, 又は 2	Y.1
E.2	(X.2)	0, 1, 又は 2	Y.1
E.3	(X.3)	0, 1, 又は 2	Y.1
E.4	(X.4)	0, 1, 又は 2	Y.1
E.5	(X.5)	0, 1, 又は 2	Y.1
E.6	(X.1)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.7	(X.2)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.8	(X.3)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.9	(X.4)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.10	(X.5)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.11	(X.1)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.12	(X.2)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.13	(X.3)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.14	(X.4)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.15	(X.5)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.16	(X.1)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.17	(X.2)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.18	(X.3)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.19	(X.4)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.20	(X.5)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.21	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.1
E.22	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.1
E.23	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.1
E.24	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.1
E.25	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.1
E.26	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.2
E.27	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.2
E.28	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.2
E.29	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.2
E.30	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.2
E.31	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.3
E.32	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.3
E.33	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.3
E.34	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.3

【 0 0 9 6 】

10

20

30

40

50

【表 4】

E.35	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.3
E.36	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.4
E.37	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.4
E.38	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.4
E.39	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.4
E.40	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.4
E.41	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.5
E.42	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.5
E.43	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.5
E.44	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.5
E.45	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.5
E.46	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.6
E.47	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.6
E.48	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.6
E.49	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.6
E.50	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.6
E.51	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.7
E.52	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.7
E.53	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.7
E.54	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.7
E.55	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.7
E.56	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.8
E.57	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.8
E.58	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.8
E.59	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.8
E.60	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.8
E.61	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.9
E.62	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.9
E.63	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.9
E.64	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.9
E.65	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.9
E.66	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.10
E.67	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.10
E.68	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.10
E.69	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.10
E.70	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.10

【 0 0 9 7 】

10

20

30

40

50

【表 5】

E.71	(X.1)	0, 1, 又は 2	Y.1
E.72	(X.2)	0, 1, 又は 2	Y.1
E.73	(X.3)	0, 1, 又は 2	Y.1
E.74	(X.4)	0, 1, 又は 2	Y.1
E.75	(X.5)	0, 1, 又は 2	Y.1
E.76	(X.1)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.77	(X.2)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.78	(X.3)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.79	(X.4)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.80	(X.5)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.81	(X.1)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.82	(X.2)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.83	(X.3)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.84	(X.4)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.85	(X.5)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.86	(X.1)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.87	(X.2)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.88	(X.3)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.89	(X.4)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.90	(X.5)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.91	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.1
E.92	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.1
E.93	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.1
E.94	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.1
E.95	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.1
E.96	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.2
E.97	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.2
E.98	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.2
E.99	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.2
E.100	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.2
E.101	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.3
E.102	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.3
E.103	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.3
E.104	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.3
E.105	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.3
E.106	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.4

【 0 0 9 8 】

10

20

30

40

50

【表 6】

E.107	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.4
E.108	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.4
E.109	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.4
E.110	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.4
E.111	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.5
E.112	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.5
E.113	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.5
E.114	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.5
E.115	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.5
E.116	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.6
E.117	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.6
E.118	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.6
E.119	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.6
E.120	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.6
E.121	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.7
E.122	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.7
E.123	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.7
E.124	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.7
E.125	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.7
E.126	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.8
E.127	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.8
E.128	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.8
E.129	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.8
E.130	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.8
E.131	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.9
E.132	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.9
E.133	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.9
E.134	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.9
E.135	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.9
E.136	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.10
E.137	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.10
E.138	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.10
E.139	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.10
E.140	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.10
E.141	(X.1)	0, 1, 又は 2	Y.1
E.142	(X.2)	0, 1, 又は 2	Y.1

【 0 0 9 9 】

10

20

30

40

50

【表 7】

E.143	(X.3)	0, 1, 又は 2	Y.1
E.144	(X.4)	0, 1, 又は 2	Y.1
E.145	(X.5)	0, 1, 又は 2	Y.1
E.146	(X.1)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.147	(X.2)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.148	(X.3)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.149	(X.4)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.150	(X.5)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.151	(X.1)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.152	(X.2)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.153	(X.3)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.154	(X.4)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.155	(X.5)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.156	(X.1)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.157	(X.2)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.158	(X.3)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.159	(X.4)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.160	(X.5)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.161	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.1
E.162	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.1
E.163	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.1
E.164	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.1
E.165	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.1
E.166	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.2
E.167	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.2
E.168	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.2
E.169	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.2
E.170	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.2
E.171	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.3
E.172	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.3
E.173	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.3
E.174	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.3
E.175	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.3
E.176	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.4
E.177	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.4
E.178	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.4

【 0 1 0 0 】

10

20

30

40

50

【表 8】

E.179	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.4
E.180	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.4
E.181	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.5
E.182	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.5
E.183	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.5
E.184	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.5
E.185	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.5
E.186	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.6
E.187	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.6
E.188	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.6
E.189	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.6
E.190	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.6
E.191	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.7
E.192	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.7
E.193	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.7
E.194	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.7
E.195	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.7
E.196	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.8
E.197	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.8
E.198	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.8
E.199	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.8
E.200	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.8
E.201	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.9
E.202	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.9
E.203	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.9
E.204	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.9
E.205	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.9
E.206	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.10
E.207	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.10
E.208	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.10
E.209	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.10
E.210	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.10
E.211	(X.1)	0, 1, 又は 2	Y.1
E.212	(X.2)	0, 1, 又は 2	Y.1
E.213	(X.3)	0, 1, 又は 2	Y.1
E.214	(X.4)	0, 1, 又は 2	Y.1
E.215	(X.5)	0, 1, 又は 2	Y.1

【 0 1 0 1 】

10

20

30

40

50

【表 9】

E.216	(X.1)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.217	(X.2)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.218	(X.3)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.219	(X.4)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.220	(X.5)	0, 1, 又は 2	Y.2
E.221	(X.1)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.222	(X.2)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.223	(X.3)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.224	(X.4)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.225	(X.5)	0, 1, 又は 2	Y.3
E.226	(X.1)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.227	(X.2)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.228	(X.3)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.229	(X.4)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.230	(X.5)	0, 1, 又は 2	Y.4
E.231	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.1
E.232	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.1
E.233	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.1
E.234	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.1
E.235	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.1
E.236	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.2
E.237	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.2
E.238	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.2
E.239	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.2
E.240	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.2
E.241	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.3
E.242	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.3
E.243	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.3
E.244	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.3
E.245	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.3
E.246	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.4
E.247	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.4
E.248	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.4
E.249	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.4
E.250	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.4
E.251	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.5

【 0 1 0 2 】

10

20

30

40

50

【表 10】

E.252	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.5
E.253	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.5
E.254	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.5
E.255	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.5
E.256	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.6
E.257	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.6
E.258	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.6
E.259	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.6
E.260	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.6
E.261	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.7
E.262	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.7
E.263	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.7
E.264	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.7
E.265	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.7
E.266	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.8
E.267	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.8
E.268	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.8
E.269	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.8
E.270	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.8
E.271	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.9
E.272	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.9
E.273	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.9
E.274	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.9
E.275	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.9
E.276	(X.1)	0, 1, 又は 2	y.10
E.277	(X.2)	0, 1, 又は 2	y.10
E.278	(X.3)	0, 1, 又は 2	y.10
E.279	(X.4)	0, 1, 又は 2	y.10
E.280	(X.5)	0, 1, 又は 2	y.10

10

20

30

40

【0103】

更なる態様において、本発明は、 R^5 が実施形態5.1で表され、且つ R^6 が実施形態6.1で表される、表Eに列挙される実施形態E.1～E.280に関する。

【0104】

更なる態様において、本発明は、 R^5 が実施形態5.2で表され、且つ R^6 が実施形態6.1で表される、表Eに列挙される実施形態E.1～E.280に関する。

【0105】

更なる態様において、本発明は、 R^5 が実施形態5.3で表され、且つ R^6 が実施形態6.1で表される、表Eに列挙される実施形態E.1～E.280に関する。

【0106】

50

更なる態様において、本発明は、 R^5 が実施形態5.5で表され、且つ R^6 が実施形態6.4で表される、表Eに列挙される実施形態E.1～E.280に関する。

50

【0123】

更なる態様において、本発明は、 R^5 及び R^6 が実施形態 6. 5 で表される、表 E に列挙される実施形態 E. 1 ~ E. 280 に関する。

【0124】

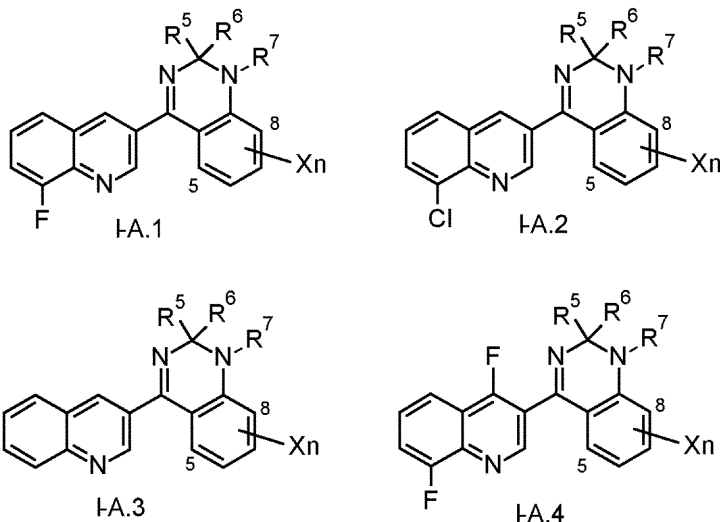
更なる態様において、本発明は、 R^5 及び R^6 が実施形態 6. 6 で表される、表 E に列挙される実施形態 E. 1 ~ E. 280 に関する。

【0125】

本発明の好ましい実施形態は、以下の化合物 I. A-1、I. A-2、I. A-3、I. A-4 である。これらの式中、置換基 R^5 、 R^6 及び X_n は、独立して、上で定義される通りであるか、又は好ましくは本明細書に定義される通りである：

10

【化 4】



20

【0126】

特にそれらの使用の観点から、一実施形態によれば、化合物 I. A-1、I. A-2、I. A-3、I. A-4 が好ましく；それらは、表 1a ~ 7a にまとめられている。表中の置換基に関して言及されている基のそれぞれは、更にそれ自体、それが言及される組合せから独立して、対象の置換基の特に好ましい態様である。

30

【0127】

表 1a X_n が H であり、各個々の化合物についての R^5 、 R^6 及び R^7 の組合せに関する意味が、各場合に、表 B の一行に対応する、式 I. A-1、I. A-2、I. A-3、I. A-4 の化合物（化合物 I. A-1. 1a. B-1 ~ I. A-1. 1a. B-100、I. A-2. 1a. B-1 ~ I. A-2. 1a. B-100、I. A-3. 1a. B-1 ~ I. A-3. 1a. B-100、I. A-4. 1a. B-1 ~ I. A-4. 1a. B-100）。

【0128】

表 2a X_n が 8-F であり、各個々の化合物についての R^5 、 R^6 及び R^7 の組合せに関する意味が、各場合に、表 B の一行に対応する、式 I. A-1、I. A-2、I. A-3、I. A-4 の化合物（化合物 I. A-1. 2a. B-1 ~ I. A-1. 2a. B-100、I. A-2. 2a. B-1 ~ I. A-2. 2a. B-100、I. A-3. 2a. B-1 ~ I. A-3. 2a. B-100、I. A-4. 2a. B-1 ~ I. A-4. 2a. B-100）。

40

【0129】

表 3a X_n が 8-Cl であり、各個々の化合物についての R^5 、 R^6 及び R^7 の組合せに関する意味が、各場合に、表 B の一行に対応する、式 I. A-1、I. A-2、I. A-3、I. A-4 の化合物（化合物 I. A-1. 3a. B-1 ~ I. A-1. 3a. B-100、I. A-2. 3a. B-1 ~ I. A-2. 3a. B-100、I. A-3. 3

50

a. B-1~I. A-3. 3 a. B-100、I. A-4. 3 a. B-1~I. A-4. 3 a. B-100)。

【0130】

表4a Xnが8-CH₃であり、各個々の化合物についてのR⁵、R⁶及びR⁷の組合せに関する意味が、各場合に、表Bの一行に対応する、式I. A-1、I. A-2、I. A-3、I. A-4の化合物(化合物I. A-1. 4 a. B-1~I. A-1. 4 a. B-100、I. A-2. 4 a. B-1~I. A-2. 4 a. B-100、I. A-3. 4 a. B-1~I. A-3. 4 a. B-100、I. A-4. 4 a. B-1~I. A-4. 4 a. B-100)。

【0131】

表5a Xnが7, 8-F₂であり、各個々の化合物についてのR⁵、R⁶及びR⁷の組合せに関する意味が、各場合に、表Bの一行に対応する、式I. A-1、I. A-2、I. A-3、I. A-4の化合物(化合物I. A-1. 5 a. B-1~I. A-1. 5 a. B-100、I. A-2. 5 a. B-1~I. A-2. 5 a. B-100、I. A-3. 5 a. B-1~I. A-3. 5 a. B-100、I. A-4. 5 a. B-1~I. A-4. 5 a. B-100)。

【0132】

表6a Xnが8-OCH₃であり、各個々の化合物についてのR⁵、R⁶及びR⁷の組合せに関する意味が、各場合に、表Bの一行に対応する、式I. A-1、I. A-2、I. A-3、I. A-4の化合物(化合物I. A-1. 6 a. B-1~I. A-1. 6 a. B-100、I. A-2. 6 a. B-1~I. A-2. 6 a. B-100、I. A-3. 6 a. B-1~I. A-3. 6 a. B-100、I. A-4. 6 a. B-1~I. A-4. 6 a. B-100)。

【0133】

表7a Xnが7-F-8-OCH₃であり、各個々の化合物についてのR⁵、R⁶及びR⁷の組合せに関する意味が、各場合に、表Bの一行に対応する、式I. A-1、I. A-2、I. A-3、I. A-4の化合物(化合物I. A-1. 7 a. B-1~I. A-1. 7 a. B-100、I. A-2. 7 a. B-1~I. A-2. 7 a. B-100、I. A-3. 7 a. B-1~I. A-3. 7 a. B-100、I. A-4. 7 a. B-1~I. A-4. 7 a. B-100)。

【0134】

10

20

30

40

50

【表 1 1】
表B

No.	R ⁷	R ⁵	R ⁶
B-1	H	CH ₃	CH ₃
B-2	CH ₃	CH ₃	CH ₃
B-3	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
B-4	CN	CH ₃	CH ₃
B-5	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
B-6	CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃
B-7	CHO	CH ₃	CH ₃
B-8	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃
B-9	C(CH ₃) ₃	CH ₃	CH ₃
B-10	CH ₂ C(CH ₃) ₃	CH ₃	CH ₃
B-11	H	C ₂ H ₅	CH ₃
B-12	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
B-13	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
B-14	CN	C ₂ H ₅	CH ₃
B-15	OCH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
B-16	CH ₂ CN	C ₂ H ₅	CH ₃
B-17	CHO	C ₂ H ₅	CH ₃
B-18	CH ₂ CH ₂ CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
B-19	C(CH ₃) ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
B-20	CH ₂ C(CH ₃) ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
B-21	H	C(CH ₃) ₃	CH ₃
B-22	CH ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃
B-23	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃	CH ₃
B-24	CN	C(CH ₃) ₃	CH ₃
B-25	OCH ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃
B-26	CH ₂ CN	C(CH ₃) ₃	CH ₃
B-27	CHO	C(CH ₃) ₃	CH ₃

【 0 1 3 5 】

10

20

30

40

50

【表 1 2】

No.	R ⁷	R ⁵	R ⁶
B-28	CH ₂ CH ₂ CH ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃
B-29	C(CH ₃) ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃
B-30	CH ₂ C(CH ₃) ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃
B-31	H	CH ₃	C ₂ H ₅
B-32	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
B-33	C ₂ H ₅	CH ₃	C ₂ H ₅
B-34	CN	CH ₃	C ₂ H ₅
B-35	OCH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
B-36	CH ₂ CN	CH ₃	C ₂ H ₅
B-37	CHO	CH ₃	C ₂ H ₅
B-38	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
B-39	C(CH ₃) ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
B-40	CH ₂ C(CH ₃) ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
B-41	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
B-42	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
B-43	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
B-44	CN	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
B-45	OCH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
B-46	CH ₂ CN	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
B-47	CHO	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
B-48	CH ₂ CH ₂ CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
B-49	C(CH ₃) ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
B-50	CH ₂ C(CH ₃) ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
B-51	H	C(CH ₃) ₃	C ₂ H ₅
B-52	CH ₃	C(CH ₃) ₃	C ₂ H ₅
B-53	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃	C ₂ H ₅
B-54	CN	C(CH ₃) ₃	C ₂ H ₅
B-55	OCH ₃	C(CH ₃) ₃	C ₂ H ₅

【 0 1 3 6】

10

20

30

40

【表 1 3】

No.	R ⁷	R ⁵	R ⁶
B-56	CH ₂ CN	C(CH ₃) ₃	C ₂ H ₅
B-57	CHO	C(CH ₃) ₃	C ₂ H ₅
B-58	CH ₂ CH ₂ CH ₃	C(CH ₃) ₃	C ₂ H ₅
B-59	C(CH ₃) ₃	C(CH ₃) ₃	C ₂ H ₅
B-60	CH ₂ C(CH ₃) ₃	C(CH ₃) ₃	C ₂ H ₅
B-61	H	CH ₃	C(CH ₃) ₃
B-62	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₃
B-63	C ₂ H ₅	CH ₃	C(CH ₃) ₃
B-64	CN	CH ₃	C(CH ₃) ₃
B-65	OCH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₃
B-66	CH ₂ CN	CH ₃	C(CH ₃) ₃
B-67	CHO	CH ₃	C(CH ₃) ₃
B-68	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₃
B-69	C(CH ₃) ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₃
B-70	CH ₂ C(CH ₃) ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₃
B-71	H	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
B-72	CH ₃	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
B-73	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
B-74	CN	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
B-75	OCH ₃	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
B-76	CH ₂ CN	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
B-77	CHO	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
B-78	CH ₂ CH ₂ CH ₃	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
B-79	C(CH ₃) ₃	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
B-80	CH ₂ C(CH ₃) ₃	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃
B-81	H	C(CH ₃) ₃	C(CH ₃) ₃
B-82	CH ₃	C(CH ₃) ₃	C(CH ₃) ₃
B-83	C ₂ H ₅	C(CH ₃) ₃	C(CH ₃) ₃

【 0 1 3 7 】

10

20

30

40

【表 1 4】

No.	R ⁷	R ⁵	R ⁶
B-84	CN	C(CH ₃) ₃	C(CH ₃) ₃
B-85	OCH ₃	C(CH ₃) ₃	C(CH ₃) ₃
B-86	CH ₂ CN	C(CH ₃) ₃	C(CH ₃) ₃
B-87	CHO	C(CH ₃) ₃	C(CH ₃) ₃
B-88	CH ₂ CH ₂ CH ₃	C(CH ₃) ₃	C(CH ₃) ₃
B-89	C(CH ₃) ₃	C(CH ₃) ₃	C(CH ₃) ₃
B-90	CH ₂ C(CH ₃) ₃	C(CH ₃) ₃	C(CH ₃) ₃
B-91	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	
B-92	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	
B-93	C ₂ H ₅	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	
B-94	CN	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	
B-95	OCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	
B-96	CH ₂ CN	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	
B-97	CHO	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	
B-98	CH ₂ CH ₂ CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	
B-99	C(CH ₃) ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	
B-100	CH ₂ C(CH ₃) ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	

10

20

30

【0138】

本発明の化合物は、以下のスキームに示されるように製造することができ、それらのスキームにおいて、特に明記しない限り、各変数の定義は、式Ⅰの化合物について上で定義された通りである。式Ⅰの化合物は、先行技術に記載されている方法に従って又は方法と同様に調製することができる。合成は、市販されている出発物質又は容易に入手可能な化合物から出発して従来の手順に従って調製され得る出発物質を利用するものである。

【0139】

例えば、式2の化合物からの化合物Ⅰの形成は、好適には、カリウム又はナトリウム低級アルコキシド又は水素化物などの塩基の存在下でのアルキル化又はアシル化によって行われる。ジ-低級アルキル硫酸も、米国特許第3,625,959号明細書に記載されているように、前記アルキル化又はアシル化を達成するために使用することができる。

40

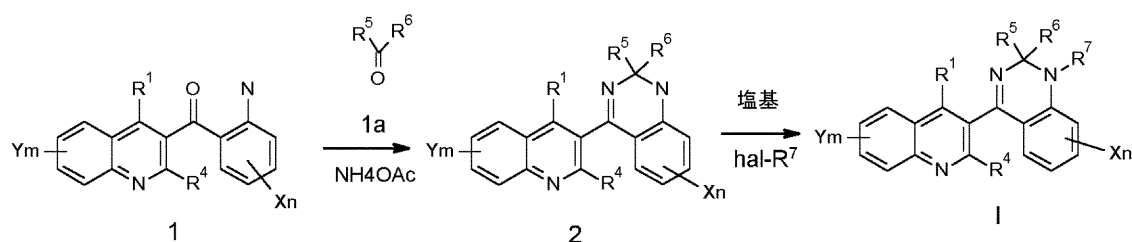
【0140】

式2の環状化合物は、酢酸アンモニウムの存在下で式1aのケトン又はアルデヒドとの反応によってケトアミン化合物1から調製することができる。いくつかの場合には、p-トルエンスルホン酸(p-TsOH)、p-トルエンスルホン酸ピリジニウム、硫酸又は酢酸のような酸の存在は、収率を向上させる(前例に関しては、例えば *Chemistry Select* (2018), 3(32), 9388-9392 及び *Organic & Biomolecular Chemistry* (2003), 1(2), 367-

50

372中を参照されたい)。

【化5】



10

【0141】

1の化合物は、市販されているか、又は以下のスキーム1に概要を述べられる一般経路に従って、*Inorganica Chimica Acta* (2012), 382, 72-78、国際公開第2000038618号パンフレット、中国特許出願公開第107879989A号明細書、*Chinese Science Bulletin* (2010), 55(25), 2817-2819に記載されているように、例えば二酸化マンガンを使用するアミノアルコール7の酸化によってアクセスすることができる。

【0142】

式7の化合物は、国際公開第2000038618号パンフレット、*Inorganica Chimica Acta* (2012), 382, 72-78に記載されているように、RANEY (登録商標) ニッケルを使用するそれぞれのニトロアルコール6の接触水素化によってアクセスすることができる。

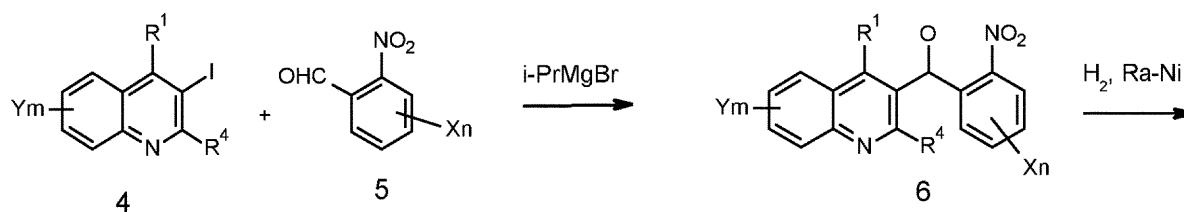
20

【0143】

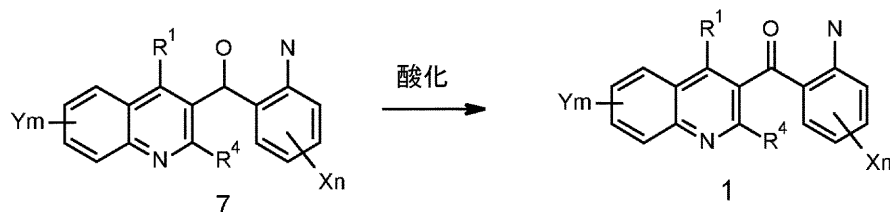
2-ニトロアルコール6は、Knochel及び同僚 (*Angew. Chem., Int. Ed.*, 2002, 41, 1610) によって記載されているように臭化イソプロピルフェニルマグネシウム媒介ヨウ素-マグネシウム交換、及び市販されているベンズアルデヒド誘導体5へのその後の付加によって4から調製することができる。

スキーム1

【化6】



30



40

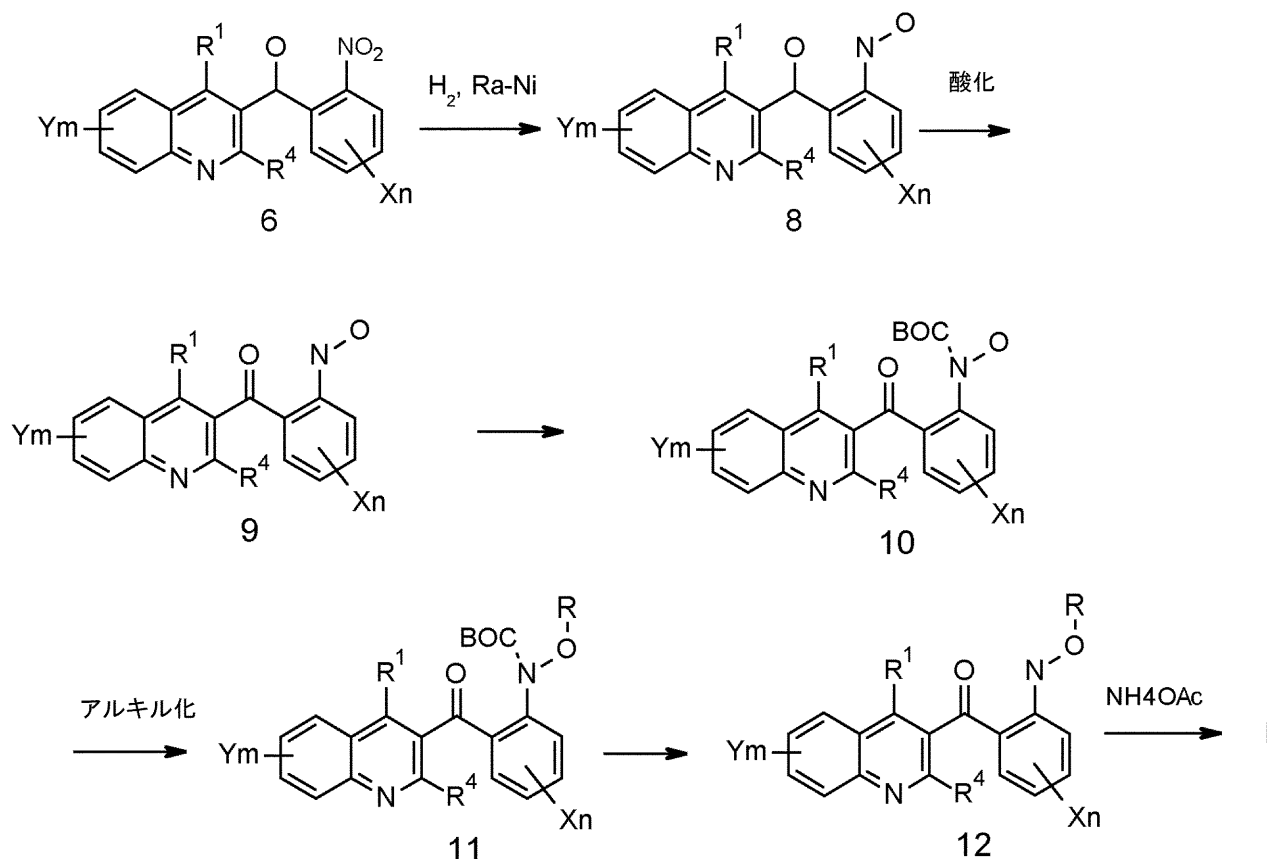
【0144】

R⁷がアルコキシである、式Iの化合物は、*RSC Advances* (2020), 28585-28594に記載されているように、水性アンモニアとDMSOとの組合せ液体によって処理された、不動態化RANEY (登録商標) ニッケルを使用するか、又はインド国特許第1996CH00112号明細書に記載されているように、炭素上白金 (Degussa製のタイプF 103 RS/W) を使用する対応するN-アリアルヒド

50

ロキシルアミン 8 へのニトロアルコール 6 の選択的接触水素化で特徴付けられる、以下の合成ルートによって 6 から調製することができる。

【化 7】



10

20

30

40

50

【0145】

式 9 の化合物は、*Inorganica Chimica Acta* (2012), 382, 72-78 及び国際公開第 2000038618 号パンフレットに記載されているように、例えば二酸化マンガンを使用するヒドロキシルアミンアルコール 8 の酸化によって調製することができる。

【0146】

保護されたヒドロキシルアミン 10 は、DMSO のような適切な溶媒中で *tert*-ブチルジカーボネートを使用する *N*-Boc のような、Theodora W. Greene の本「*Protective Groups in Organic Synthesis*」に論じられているようなアミノ保護基に関する文献において周知の方法によって調製することができる。

【0147】

化合物 10 は、LDA、NaH、又は NaHMDS のような標準塩基を使用してヒドロキシルアミンを脱プロトン化し、引き続き適切な溶媒中のハライド、メシレート、又はトリフレートのような適切な脱離基を持ったアルキル化剤を添加し、アルキル化して化合物 11 を提供することができる（前例に関しては例えば中国特許第 207973751 号明細書を参照されたい）。

【0148】

N-Boc 保護基は、塩化メチレン中の TFA のような文献で周知の幾つもの方法によって除去して化合物 12 を得ることができる（前例に関しては例えば国際公開第 2000038618 号パンフレットを参照されたい）。

【0149】

最後に、 R^7 がアルコキシである、化合物 I は、*Chemistry Select*

(2018), 3(32), 9388-9392及びOrganic & Biomolecular Chemistry(2003), 1(2), 367-372に記載されているようにNH₄OAcで処理することによって12から調製することができる。

【0150】

化合物I及びその組成物は、それぞれ、土壤伝染性真菌を含む、幅広い植物病原菌、特に、ネコブカビ綱(Plasmodiophoromycetes)、卵菌綱(Perothozomycetes)(卵菌類(Oomycetes)と同義)、ツボカビ綱(Chytridiomycetes)、接合菌類(Zygomycetes)、子囊菌類(Ascomycetes)、担子菌類(Basidiomycetes)、及び不完全菌類(Deuteromycetes)(不全菌類(Fungi imperfecti)と同義)のクラスに由来するものに対して有効な殺真菌剤として好適である。それらは、葉面殺真菌剤、種子粉衣用殺真菌剤、及び土壤殺真菌剤として作物保護に使用することができる。

10

【0151】

化合物I及びその組成物は、好ましくは、様々な栽培植物、例えば穀物、例えばコムギ、ライムギ、オオムギ、ライコムギ、オートムギ又はイネ；ビート、例えばテンサイ又は飼料用ビート；果物、例えばナシ状果(リンゴ、ナシ等)、石果(例えば、プラム、モモ、アーモンド、サクランボ)、又は液果とも呼ばれる、ソフトフルーツ(イチゴ、ラズベリー、ブラックベリー、スグリ等)；マメ科植物、例えばレンズマメ、エンドウ、アルファルファ、又はダイズ；油脂植物、例えばナタネ、カラシ、オリーブ、ヒマワリ、ココナツ、カカオ豆、ヒマシ油植物、アブラヤシ、ピーナツ、又はダイズ；ウリ科植物、例えばカボチャ、キュウリ、又はメロン；繊維植物、例えばワタ、アマ、大麻、又はオウマ；柑橘類、例えばオレンジ、レモン、グレープフルーツ、又はマンダリン；野菜、例えばホウレンソウ、レタス、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、タマネギ、トマト、ジャガイモ、ウリ類、又はパプリカ；クスノキ科植物、例えばアボカド、シナモン、又はカンファー；エネルギー及び原料植物、例えばトウモロコシ、ダイズ、ナタネ、サトウキビ、又はアブラヤシ；トウモロコシ；タバコ；ナツ；コーヒー；茶；バナナ；ブドウ(テーブルグレイプ及びグレイプジュース用ブドウ)；ホップ；シバ；ハイノキ(ステビアとも呼ばれる)；天然ゴム植物；又は観葉植物及び森林植物、例えば花、低木、広葉樹、又は常緑樹(針葉樹、ユーカリ等)などに係る；種子などの植物繁殖材料に係る；並びにこれらの植物の作物材料に係る植物病原菌の防除に有用である。

20

30

【0152】

より好ましくは、化合物I及びその組成物は、それぞれ、農作物、例えばジャガイモ、テンサイ、タバコ、コムギ、ライムギ、オオムギ、オートムギ、イネ、トウモロコシ、ワタ、ダイズ、ナタネ、マメ科植物、ヒマワリ、コーヒー又はサトウキビ；果物；ブドウ；観葉植物；又は野菜、例えばキュウリ、トマト、マメ又はカボチャなどに係る真菌を防除するために使用される。

【0153】

「植物繁殖材料」という用語は、種子などの植物の生殖部分；並びに植物の増殖のために使用できる、挿し木及び塊茎(例えば、ジャガイモ)などの、生長能力がある植物材料を全て示すと理解される。これには、植物の種子、根、果実、塊茎、球根、根茎、芽、新芽並びに発芽後又は土壌から出た後に移植される苗及び若い植物を含む、他の部分が含まれる。

40

【0154】

好ましくは、化合物I及びその組成物での植物繁殖材料の処理は、それぞれ、コムギ、ライムギ、オオムギ及びオートムギなどの、穀物；イネ、トウモロコシ、ワタ及びダイズに係る真菌を防除するために使用される。

【0155】

本発明によれば、上記の栽培植物の全ては、特に、コムギ及びオオムギなどの穀物、並びにナタネにおける冬品種及び春品種、例えば冬コムギ、春コムギ、冬オオムギ等を含む

50

が、それらに限定されない、それぞれの栽培植物に属する全ての種、亜種、変種、品種及び／又は雑種を含むと理解される。

【0156】

トウモロコシは、飼料用トウモロコシ及びスイートコーンなどのあらゆる種類のトウモロコシを含むトウモロコシ (Indian corn) 又はトウモロコシ (maize) (Zea mays) としても知られている。本発明によれば、全てのトウモロコシ (maize) 又はトウモロコシ (corn) の亜種及び／若しくは変種、特にフラワーコーン (Zea mays var. amylacea)、ポップコーン (Zea mays var. everta)、デントコーン (Zea mays var. indentata)、フリントコーン (Zea mays var. indurata)、スイートコーン (Zea mays var. saccharata 及び var. rugosa)、ワキシコーン (Zea mays var. ceratina)、アミロメイズ (高アミロース Zea mays 品種)、ポッドコーン又はワイルドメイズ (Zea mays var. tunicata) 並びにストライプドトウモロコシ (Zea mays var. japonica) が含まれる。

10

【0157】

ほとんどのダイズ品種は、無限及び有限生育習性に分類されるが、ダイズの野生の祖先であるグリシンソージャ (Glycine soja) は、無限である (PNAS 2010, 107 (19) 8563-856)。無限生育習性 (成熟度グループ、MG 00 ~ MG 4.9) は、開花が始まった後の植物成長の継続で特徴付けられ、一方、有限ダイズ品種 (MG 5 ~ MG 8) は、開花が始まった時点でそれらの植物成長の大部分が終了していることを特徴とする。本発明によれば、全てのダイズ栽培品種又は品種が含まれ、特に無限及び有限栽培品種又は品種が含まれる。

20

【0158】

「栽培植物」という用語は、植物に新たな形質を付与するか又は既に存在する形質を改変するために突然変異誘発又は遺伝子工学により改変されている植物を含むものとして理解される。突然変異誘発は、X線又は変異原性化学物質を使用するランダム突然変異誘発のみならず、植物ゲノムの特定の遺伝子座に突然変異を生み出すための標的突然変異誘発も含む。標的突然変異誘発は、多くの場合に、オリゴヌクレオチド又は CRISPR/Cas、ジンク・フィンガーヌクレアーゼ、TALEN 又はメガヌクレアーゼのようなタンパク質を使用する。遺伝子工学は、通常、自然環境下では交配、突然変異誘発又は自然の組換えによって容易に得ることができない改変を植物ゲノム生み出すために、組換え DNA 技法を用いる。典型的には、形質を追加する又は形質を改良する若しくは改変するために1又は複数の遺伝子が植物のゲノムに組み込まれる。これらの組み込まれる遺伝子は、導入遺伝子とも言われ、一方、そのような導入遺伝子を含む植物は、遺伝子導入植物と言われる。植物形質転換のプロセスでは、通常、導入遺伝子が組み込まれるゲノム遺伝子座が異なる、幾つかの形質転換イベントが生じる。特定のゲノム遺伝子座に特定の導入遺伝子を含む植物は、通常、特定の「イベント」を含むと表現され、それは、特定のイベント名で参照される。植物中に導入されているか又は改変されている形質としては、除草剤耐性、昆虫抵抗性、高い収量及び干ばつのような、非生物的条件に対する耐性が挙げられる。

30

40

【0159】

除草剤耐性は、突然変異誘発及び遺伝子工学を用いることによって生み出される。突然変異誘発及び育種によってアセト乳酸合成酵素 (ALS) 阻害剤除草剤に対して耐性にされた植物は、例えば、名称 Clearfield (登録商標) で入手可能である。グリホサート、グルホシネート、2, 4-D、ジカンバ、プロモキシニル及びイオキシニルのような、オキシニル除草剤、スルホニルウレア除草剤、ALS 阻害剤並びにイソオキサフルトール及びメソトリオンのような、4-ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ (HPPD) 阻害剤に対する除草剤耐性が、導入遺伝子の使用により生み出される。

【0160】

50

除草剤耐性形質を付与する導入遺伝子は、以下を含む：グリホサート耐性付与：cp4 epsps、epsps grg23ace5、mepsps、2mepsps、gat4601、gat4621、goxv247；グルホシネート耐性付与：pat及びbar；2，4-D耐性付与：aad-1、aad-12；ジカンバ耐性付与：dmo；オキシニル除草剤耐性付与：bxn；スルホニルウレア除草剤耐性付与：zm-hra、csr1-2、gm-hra、S4-HrA；ALS阻害剤耐性付与：csr1-2；並びにHPPD阻害剤耐性付与：hppdPF、W336、avhppd-03。

【0161】

除草剤耐性遺伝子を含む遺伝子導入トウモロコシイベントには、DAS40278、MON801、MON802、MON809、MON810、MON832、MON87411、MON87419、MON87427、MON88017、MON89034、NK603、GA21、MZHGOJG、HCEM485、VCO-Φ1981-5、676、678、680、33121、4114、59122、98140、Bt10、Bt176、CBH-351、DBT418、DLL25、MS3、MS6、MZIR098、T25、TC1507及びTC6275が含まれるが、それらに限定されない。除草剤耐性遺伝子を含む遺伝子導入ダイズイベントには、GTS40-3-2、MON87705、MON87708、MON87712、MON87769、MON89788、A2704-12、A2704-21、A5547-127、A5547-35、DP356043、DAS44406-6、DAS68416-4、DAS-81419-2、GU262、SYHTΦH2、W62、W98、FG72及びCV127が含まれるが、それらに限定されない。除草剤耐性遺伝子を含む遺伝子導入ワタイイベントには、19-51a、31707、42317、81910、281-24-236、3006-210-23、BXN10211、BXN10215、BXN10222、BXN10224、MON1445、MON1698、MON88701、MON88913、GHB119、GHB614、LLCotton25、T303-3及びT304-40が含まれるが、それらに限定されない。除草剤耐性遺伝子を含む遺伝子導入キャノーライイベントは、例えば、MON88302、HCR-1、HCN10、HCN28、HCN92、MS1、MS8、PHY14、PHY23、PHY35、PHY36、RF1、RF2及びRF3であるが、他を排除しない。

【0162】

昆虫耐性を付与する導入遺伝子は、好ましくは、cry1A、cry1Ab、cry1Ab-Ac、cry1Ac、cry1A.105、cry1F、cry1Fa2、cry2Ab2、cry2Ae、mcry3A、ecry3.1Ab、cry3Bb1、cry34Ab1、cry35Ab1、cry9C、vip3A(a)、vip3Aa20のような、バシラス属菌種 (*Bacillus spp.*) の毒素遺伝子及びそれらの合成変異体である。更に、CpTI及びpinIIのような、プロテアーゼ阻害剤をコードする遺伝子などの、植物由来の導入遺伝子を用いることもできる。更なるアプローチは、dvsnf7などの導入遺伝子を用いて植物において二本鎖RNAを産生する。

【0163】

殺虫性タンパク質又は二本鎖RNAの遺伝子を含む遺伝子導入トウモロコシイベントには、Bt10、Bt11、Bt176、MON801、MON802、MON809、MON810、MON863、MON87411、MON88017、MON89034、33121、4114、5307、59122、TC1507、TC6275、CBH-351、MIR162、DBT418及びMZIR098が含まれるが、それらに限定されない。殺虫性タンパク質の遺伝子を含む遺伝子導入ダイズイベントには、MON87701、MON87751及びDAS-81419が含まれるが、それらに限定されない。殺虫性タンパク質の遺伝子を含む遺伝子導入ワタイイベントには、SGK321、MON531、MON757、MON1076、MON15985、31707、31803、31807、31808、42317、BNLA-601、Event1、COT67B、COT102、T303-3、T304-40、GFMCry1A、GK12、MLS9

124、281-24-236、3006-210-23、GHB119及びSGK321が含まれるが、それらに限定されない。

【0164】

導入遺伝子athb17（例えば、トウモロコシイベントMON87403）、又はbxb32（例えば、ダイズイベントMON87712）を用いることによって収量が増加した栽培植物が生み出されている。

【0165】

油量が改変された栽培植物は、導入遺伝子：gm-fad2-1、Pj.D6D、Nc.Fad3、fad2-1A及びfatb1-A（例えば、ダイズイベント260-05、MON87705及びMON87769）を用いることによって生み出されている。

10

【0166】

干ばつなどの、非生物的条件に対する耐性は、導入遺伝子cspB（トウモロコシイベントMON87460）及びHahb-4（ダイズイベントIND-ΦΦ41Φ-5）を用いることによって生み出されている。

【0167】

形質は、多くの場合、形質転換イベントにおいて遺伝子を組み合わせることによって又は育種プロセス中に異なるイベントを組み合わせることによって組み合わせられ、積み重ねられた形質を持った栽培植物をもたらす。形質の好ましい組合せは、異なる群の除草剤に対する除草剤耐性形質の組合せ、異なる種類の昆虫に対する昆虫耐性、特に鱗翅目及び鞘翅目昆虫に対する耐性の組合せ、除草剤耐性と1種又は数種の昆虫耐性との組合せ、除草剤耐性と収量増加との組合せ並びに除草剤耐性と非生物的条件に対する耐性との組合せである。

20

【0168】

単一形質又は積み重ねられた形質を含む植物並びにこれらの形質を付与する遺伝子及びイベントは、当技術分野においてよく知られている。例えば、突然変異遺伝子又は統合遺伝子及びそれぞれのイベントに関する詳細な情報は、団体「国際アグリバイオ事業団（International Service for the Acquisition of Agri-biotech Applications）（ISAAA）」のウェブサイト（<http://www.isaaa.org/gmapprovaldata>）及び団体「環境リスク評価センター（Center for Environmental Risk Assessment）（CERA）」のウェブサイト（<http://cera-gmc.org/GMCropDatabase>）から入手可能である。特定のイベント及びそれらの検出方法に関する更なる情報は、キャノーライイベントMS1、MS8、RF3、GT73、MON88302、KK179に関して、国際公開第01/031042号パンフレット、国際公開第01/041558号パンフレット、国際公開第01/041558号パンフレット、国際公開第02/036831号パンフレット、国際公開第11/153186号パンフレット、国際公開第13/003558号パンフレット；ワタイイベントMON1445、MON15985、MON531（MON15985）、LLCotton25、MON88913、COT102、281-24-236、3006-210-23、COT67B、GHB614、T304-40、GHB119、MON88701、81910に関して、国際公開第02/034946号パンフレット、国際公開第02/100163号パンフレット、国際公開第02/100163号パンフレット、国際公開第03/013224号パンフレット、国際公開第04/072235号パンフレット、国際公開第04/039986号パンフレット、国際公開第05/103266号パンフレット、国際公開第05/103266号パンフレット、国際公開第06/128573号パンフレット、国際公開第07/017186号パンフレット、国際公開第08/122406号パンフレット、国際公開第08/151000号パンフレット、国際公開第12/134808号パンフレット、国際公開第13/112527号パンフレット；トウモロコシイベントGA21、MON810、DLL25、TC1507、MON863、MIR604、LY038、MON88017、32

30

40

50

72、59122、NK603、MIR162、MON89034、98140、32138、MON87460、5307、4114、MON87427、DAS40278、MON87411、33121、MON87403、MON87419に関して、国際公開第98/044140号パンフレット、米国特許出願公開第02/102582号明細書、米国特許出願公開第03/126634号明細書、国際公開第04/099447号パンフレット、国際公開第04/011601号パンフレット、国際公開第05/103301号パンフレット、国際公開第05/061720号パンフレット、国際公開第05/059103号パンフレット、国際公開第06/098952号パンフレット、国際公開第06/039376号パンフレット、米国特許出願公開第2007/292854号明細書、国際公開第07/142840号パンフレット、国際公開第07/140256号パンフレット、国際公開第08/112019号パンフレット、国際公開第09/103049号パンフレット、国際公開第09/111263号パンフレット、国際公開第10/077816号パンフレット、国際公開第11/084621号パンフレット、国際公開第11/062904号パンフレット、国際公開第11/022469号パンフレット、国際公開第13/169923号パンフレット、国際公開第14/116854号パンフレット、国際公開第15/053998号パンフレット、国際公開第15/142571号パンフレット；ジャガイモイベントE12、F10、J3、J55、V11、X17、Y9に関して、国際公開第14/100910号パンフレット、国際公開第14/100913号パンフレット、国際公開第14/100941号パンフレット、国際公開第14/179276号パンフレット、国際公開第16/183445号パンフレット、国際公開第17/062831号パンフレット、国際公開第17/062825号パンフレット；イネイベントLLRICE06、LLRICE601、LLRICE62に関して、国際公開第00/026345号パンフレット、国際公開第00/026356号パンフレット、国際公開第00/026345号パンフレット；及びダイズイベントH7-1、MON89788、A2704-12、A5547-127、DP305423、DP356043、MON87701、MON87769、CV127、MON87705、DAS68416-4、MON87708、MON87712、SYHT0H2、DAS81419、DAS81419×DAS44406-6、MON87751に関して、国際公開第04/074492号パンフレット、国際公開第06/130436号パンフレット、国際公開第06/108674号パンフレット、国際公開第06/108675号パンフレット、国際公開第08/054747号パンフレット、国際公開第08/002872号パンフレット、国際公開第09/064652号パンフレット、国際公開第09/102873号パンフレット、国際公開第10/080829号パンフレット、国際公開第10/037016号パンフレット、国際公開第11/066384号パンフレット、国際公開第11/034704号パンフレット、国際公開第12/051199号パンフレット、国際公開第12/082548号パンフレット、国際公開第13/016527号パンフレット、国際公開第13/016516号パンフレット、国際公開第14/201235号パンフレットに見いだすことができる。

10

20

30

40

50

【0169】

栽培植物上での、それぞれ、化合物I及びその組成物の使用は、特定の導入遺伝子又はイベントを含む栽培植物に特異的である効果をもたらし得る。これらの効果は、成長挙動の変化又は生物学的若しくは非生物学的ストレス因子に対する変化した耐性を含み得る。そのような効果は、特に、収量の増加、昆虫、線虫、真菌、細菌、マイコプラズマ、ウイルス又はウイロイド病原体に対する抵抗性又は耐性の向上及び早期生長、早熟又は遅延成熟、低温又は高温耐性並びにアミノ酸又は脂肪酸スペクトル又は含有量の変化を含み得る。

【0170】

化合物I及びその組成物は、それぞれ、以下の植物病害の病因の防除に特に好適である：

観賞植物、野菜（例えば、A.カンジダ（*A. candida*））及びヒマワリ（例えば、A.トラゴポゴニス（*A. tragopogonis*））に係るアルブゴ種（*Alb*

ugo) (白さび病) ; 野菜 (例えば、A. ダウシ (A. dauci) 又は A. ポルリ (A. porri))、ナタネ (A. ブラシシコラ又はブラシカエ (A. brassicicola or brassicae))、テンサイ (A. テヌイス (A. tenuis))、果実 (例えば、A. グランディス (A. grandis))、イネ、ダイズ、ジャガイモ及びトマト (例えば、A. ソラニ (A. solani)、A. グランディス (A. grandis) 又は A. アルテルナタ (A. alternata))、トマト (例えば、A. ソラニ (A. solani) 又は A. アルテルナタ (A. alternata)) 及びコムギ (例えば、A. トリチシナ (A. trititcina)) に係るアルテルナリア種 (Alternaria) (アルテルナリア斑点病) ; テンサイ及び野菜に係るアフノマイセス種 (Aphanomyces) ; 穀物及び野菜に係るアスコキタ種 (Ascochyta)、例えばコムギに係る A. トリチシ (A. trititici) (炭疽病) 及びオオムギに係る A. ホルデイ (A. hordei) ; トウモロコシに係る眼紋病 (Aureobasidium zeae) (褐斑病 (Kapatella zeae) と同義) ; トウモロコシに係るビポラリス種 (Bipolaris) 及びドレシュレラ種 (Drechslera) (テレオモルフ：コクリオボルス種 (Cochliobolus))、例えばごま葉枯病 (D. マイデイス (D. maydis)) 又はすす紋病 (B. ゼイコラ (B. zeicola))、例えば穀物に係る斑点病 (B. ソロキニアナ (B. sorokiniana)) 並びに例えばイネ及びシバに係る B. オリザエ (B. oryzae) ; 穀物に係る (例えば、コムギ又はオオムギに係る) ブルメリア (Blumeria) (以前にはエリシフェ (Erysiphe))・グラミニス (graminis) (ウドンコ病) ; 果実及び液果 (例えば、イチゴ)、野菜 (例えば、レタス、ニンジン、セロリ及びキャベツ) に係る灰色かび病菌 (Botrytis cinerea) (テレオモルフ：ボトリチニア・フッケリアナ (Botryotinia fuckeliana) : 灰色かび病) ; タマネギ科)、ナタネ、観賞植物 (例えば、B エリプチカ (B. eliptica))、ブドウ、森林植物及びコムギに係る白斑葉枯病 (B. squamosa) 又は灰色腐敗病 (B. alli) ; レタスに係るブレミア・ラクツカエ (Bremia lactucae) (べと病) ; 落葉樹及び常緑樹に係るセラトシスチス種 (Ceratomyces) (オフィオストマ (Ophiostoma) と同義) (根腐れ病又は立ち枯れ病)、例えばニレに係る C. ウルミ (C. ulmi) (オランダニレ病) ; トウモロコシ (例えば、灰斑病：C. ゼアエーマイデイス (C. zeae-maydis))、イネ、テンサイ (例えば、C. ベチコラ (C. beticola))、サトウキビ、野菜、コーヒー、ダイズ (例えば、C. ソジナ (C. soja) 又は C. キクチイ (C. kikuchi)) 及びイネに係るセルコスポラ種 (Cercospora) (セルコスポラ斑点病) ; マッシュルームに係るクラドボトリウム (ダクチリウム (Dactylium) と同義) 種 (Cladobotryum) (例えば、C. ミコフィラム (C. mycophilum))

(以前にはダクチリウム・デンドロイデス (Dactylium dendroide)、テレオモルフ：ネクトリア・アルベルティニイ (Nectria albertini)、ネクトリア・ロゼラ (Nectria rosella)、ヒポマイセス・ロセルルス (Hypomyces rosellus) と同義) ; トマト (例えば、C. フルブム (C. fulvum) : 葉かび病) 及び穀物に係るクラドスポリウム種 (Cladosporium)、例えばコムギに係る C. ヘルバルム (C. herbarum) (黒変病) ; 穀物に係るクラビセプス・プルプレア (Claviceps purpurea) (麦角) ; トウモロコシ (C. カルボナム (C. carbonum))、穀物 (例えば、C. サチブス (C. sativus)、アナモルフ：B. ソロキニアナ (B. sorokiniana)) 及びイネ (例えば、C. ミヤベアヌス (C. miyabeanus)、アナモルフ：H. オリザエ (H. oryzae)) に係るコクリオボルス (Cochliobolus) (アナモルフ：ビポラリス (Bipolaris) のヘルミントスポリウム (Helminthosporium)) 種 (斑点病) ; ワタ (例えば、C. ゴシピイ (C. gossypii))、トウモロコシ (例えば、C. グラミニコラ (C. gram

10

20

30

40

50

inicola) :炭疽病根腐れ)、ソフトフルーツ、ジャガイモ(例えば、*C. coccodes*) :黒点病)、マメ類(例えば、*C. lindemuthianum*)、ダイズ(例えば、*C. truncatum*)又は*C. gloeosporioides*)、野菜(例えば、*C. lagenarium*)又は*C. capsici*)、果実(例えば、*C. acutatum*)、コーヒー(例えば、*C. coffeanum*)又は*C. kahawae*)に係るコレトリウム(*Colletotrichum*) (テレオモルフ:グロメラ(*Glomerella*))種(炭疽病)及び様々な作物に係る*C. gloeosporioides*; イネに係るコルチキウム種(*Corticium*)、例えば*C. sasakii* (紋枯病); ダイズ、ワタ及び観賞植物に係るコリネスポラ・カッシイコラ(*Corynespora cassicola*) (斑点病); シクロコニウム種(*Cyloconium*)、例えば、オリーブの木に係る*C. oleaginum*; 果樹、ブドウ(例えば、*C. liriodendri*)、テレオモルフ:ネオネクトリア・リリオデンドリ(*Neonectria liriodendri*)、黒足病)及び観賞植物に係るシリンドロカルボン種(*Cylindrocarpon*) (例えば、果樹潰瘍病又は幼ブドウ衰弱、テレオモルフ:ネクトリア種(*Nectria*)又はネオネクトリア種(*Neonectria*)); ダイズに係るデマトフォラ(*Dematophora*) (テレオモルフ:ロゼリニア(*Rosellinia*))・ネカトリクス(*necatrix*) (根及び茎腐れ病); ダイズに係るディアポルテ種(*Diaporthe*)、例えば*D. phaseolorum* (苗立ち枯れ病); (ヘルミントスポリウム(*Helminthosporium*)と同義、テレオモルフ:トウモロコシ、穀物、例えばオオムギ(例えば、*D. teres*)、網斑病)、及びコムギ(例えば、*D. tritici-repentis*):黄褐色斑病)、イネ及びシバに係るドレシュレラ(*Drechslera*) (ヘルミントスポリウム(*Helminthosporium*)と同義、テレオモルフ:ピレノフォラ(*Pyrenophora*))種; ホルミチポリア(*Formitiporia*) (フェリヌス(*Pheellinus*)と同義)・プンクタタ(*punctata*)、*F. mediterranea*、フェオモニエラ・クラミドスポラ(*Phaeomonieella chlamydospora*) (以前にはフェオアクレモニウム・クラミドスポルム(*Phaeoacremonium chlamydosporum*))、フェオアクレモニウム・アレオフィルム(*Phaeoacremonium aleophilum*)及び/又はボトリオスフェリア・オブツサ(*Botryosphaeria obtusa*)によって引き起こされる、ブドウに係るエスカ(*Esca*)病(胴枯病、アポブレキシー); ナシ状果(*E. pyri*)、ソフトフルーツ(*E. veneta*):炭疽病)及びブドウ(*E. ampelina*):炭疽病)に係るエルシノエ(*Elsinoe*)種; イネに係るエンチロマ・オリザエ(*Entyloma oryzae*) (葉すす病); コムギに係るエピコックム種(*Epicoccum*) (黒かび病); テンサイ(*E. betae*)、野菜(例えば、*E. pisi*)、例えばウリ科植物(例えば、*E. cichoracearum*)、キャベツ、ナタネ(例えば、*E. cruciferarum*)に係るエリシフェ種(*Erysiphe*) (ウドンコ病); 果樹、ブドウ及び観賞樹に係るユーチパ・ラタ(*Eutypa lata*) (ユーチパ潰瘍病又は胴枯病、アナモルフ:シトスポリナ・ラタ(*Cytosporina lata*)、リベルテラ・ブレファリス(*Libertella blepharis*)と同義); トウモロコシに係るエクセロヒルム(*Exserohilum*) (ヘルミントスポリウム(*Helminthosporium*)と同義)種; 様々な植物に係るフザリウム(*Fusarium*) (テレオモルフ:ジベレラ(*Gibberella*))種(立ち枯れ病、根又は茎腐れ病)、例えば穀物(例えば、コムギ又

10

20

30

40

50

はオオムギ)に係るF. グラミネアルム (F. *graminearum*) 又はF. クルモ
 ルム (F. *culmorum*) (根腐れ病、黒星病又は赤かび病)、トマトに係るF. オ
 キシスポルム (F. *oxysporum*)、ダイズに関して突然死症候群をそれぞれ引き
 起こすF. ソラニ (F. *solani*) (f. グリシネス種 (f. *sp. glycine*
s)、現在のF. ビルグリフォルメ (F. *virguliforme*) と同義) 並びにF.
 ツクマニアエ (F. *tucumaniae*) 及びF. ブラシリエンス (F. *brasi*
liense)、並びにトウモロコシに係るF. ベルチシリオイデス (F. *vertic*
illioides) ; 穀物 (例えば、コムギ又はオオムギ) 及びトウモロコシに係るゲ
 ウマノマイセス・グラミニス (*Gaeumannomyces graminis*) (立
 ち枯れ病) ; 穀物 (例えば、G. ゼアエ (G. *zeae*)) 及びイネ (例えば、G. フジ
 クロイ (G. *fujikuroi*) : 馬鹿苗病) に係るジベレラ種 (*Gibberella*
a) ; ; ブドウ、ナシ状果及び他の植物に係るグロメレラ・シングラタ (*Glomere*
lla cingulata) 並びにワタに係るG. ゴシパイ (G. *gossypii*)
 ; イネに係る穀粒ステイン複合病 ; ブドウに係るギグナルディア・ビドウェリ (*Guig*
nardia bidwellii) (黒腐れ病) ; バラ科植物及び杜松に係るギムノス
 ポランギウム種 (*Gymnosporangium*)、例えばナシに係るG. サビナエ (*G. sabinae*) (さび病) ; トウモロコシ、穀物、ジャガイモ及びイネに係るヘル
 ミントスポリウム種 (*Helminthosporium*) (ドレシュレラ (*Drechs*
lera) と同義、テレオモルフ : コクリオボルス (*Cochliobolus*)) ;
 ヘミレイア種 (*Hemileia*)、例えばコーヒーに係るH. バスタトリクス (H. *v*
astatrix) (コーヒー葉さび病) ; ブドウに係るイサリオプシス・クラビスポラ
 (*Isariopsis clavispora*) (クラドスポリウム・ビチス (*Cladospo*
rium vitis) と同義) ; ダイズ及びワタに係るマクロフォミナ・フ
 アセオリナ (*Macrophomina phaseolina*) (ファセオリ (*pha*
seoli) と同義) (根及び茎腐れ病) ; 穀物 (例えば、コムギ又はオオムギ) に係る
 ミクロドキウム (*Microdochium*) (フザリウム (*Fusarium*) と同義)
 ・ニバレ (*nivale*) (ピンク雪かび病) ; ダイズに係るミクロスフェラ・ディフ
 ユーザ (*Microsphaera diffusa*) (ウドンコ病) ; 石果及び他のバ
 ラ科植物に係るモニリニア種 (*Monilinia*)、例えばM. ラクサ (M. *laxa*
)、M. フルクチコラ (M. *fructicola*) 及びM. フルクチゲナ (M. *fru*
ctigena) (モニリア種 (*Monilia*) と同義 : 花枯病及び枝枯病、褐色腐れ
 病) ; 穀物、バナナ、ソフトフルーツ及びラッカセイに係るマイコスフェラ種 (*Myc*
osphaerella)、例えばコムギに係るM. グラミニコラ (M. *gramini*
cola) (アナモルフ : コムギ葉枯病菌 (*Zymoseptoria tritici*
)、以前にはセプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) : セプトリア
 斑点病) 又はバナナに係るM. フィジエンシス (M. *fijiensis*) (プソイドセル
 コスポラ・フィジエンシス (*Pseudocercospora fijiensis*
) と同義 : 黒シガトカ病) 及びM. ムシコラ (M. *musicola*)、ラッカセイに係
 るM. アラキジコラ (M. *arachidicola*) (M. アラキジス (M. *arac*
hidis) 又はセルコスポラ・アラキジス (*Cercospora arachidi*
s) と同義)、M. ベルケレイイ (M. *berkeleyi*)、エンドウに係るM. ピシ
 (M. *pisi*) 及びアブラナ科植物に係るM. ブラシシオラ (M. *brassicio*
la) ; キャベツ (例えば、P. ブラシカエ (P. *brassicae*))、ナタネ (例
 えば、P. パラサイチカ (P. *parasitica*))、タマネギ (例えば、P. デス
 トラクター (P. *destructor*))、タバコ (P. タバキナ (P. *tabaci*
na)) 及びダイズ (例えばP. マンシュリカ (P. *manshurica*)) に係るペ
 ロノスポラ種 (*Peronospora*) (べと病) ; ダイズに係るファコプソラ・パキ
 リジ (*Phakopsora pachyrhizi*) 及びP. メイボミアエ (P. *me*
ibomiae) (ダイズさび病) ; 例えばブドウ (例えば、P. トラケイフィラ (P.
tracheiphila) 及びP. テトラスポラ (P. *tetraspora*)) 並び

10

20

30

40

50

にダイズ（例えば、*P. gregata*）：茎腐れ病）に係るフィアロフォラ種（*Phialophora*）；ナタネ及びキャベツに係るフォマ・リンガム（*Phoma lingam*）（レプトスフェリア・ビグロボサ（*Leptosphaeria biglobosa*）及び*L. maculans*）と同義：根及び茎腐れ病）、テンサイに係る*P. betae*（根腐れ病、斑点病及び苗立ち枯れ病）及びトウモロコシに係る*P. zeae-maydis*（フィルロスチカ・ゼアエ（*Phyllostica zeae*）と同義）；ヒマワリ、ブドウ（例えば、*P. viticola*）：茎葉斑点病）及びダイズ（例えば、茎腐れ病：*P. phaseoli*）、テレオモルフ：ディアポルテ・ファゼオロルム（*Diaporthe phaseolorum*））に係るフォモプシス種（*Phomopsis*）；トウモロコシに係るフィゾデルマ・マイデイス（*Physotherma maydis*）（褐色斑病）；様々な植物、例えばパプリカ及びウリ科植物（例えば、*P. capsici*）、ダイズ（例えば、*P. megasperma*）、*P. sojae*）と同義）、ジャガイモ及びトマト（例えば、*P. infestans*）：葉腐れ病）並びに落葉樹（例えば、*P. ramorum*）：オークの突然死）に係るフィトフトラ種（*Phytophthora*）（立ち枯れ病、根、葉、果実及び茎腐れ病）；キャベツ、ナタネ、ダイコン及び他の植物に係るプラスモディフォラ・ブラシカエ（*Plasmodiophora brassicae*）（クラブ根病）；プラスモパラ種（*Plasmopara*）、例えばブドウに係る*P. viticola*（ブドウのべと病）及びヒマワリに係る*P. halstedii*；バラ科植物、ホップ、ナシ状果類及びソフトフルーツ（例えば、リンゴに係る*P. leucotricha*）及びウリ科植物（*P. xanthii*））に係るポドスフェラ種（*Podosphaera*）（ウドンコ病）；例えば、オオムギ及びコムギ（*P. graminis*）などの穀物及びテンサイ（*P. betae*）に係るポリミキサ種（*Polymyxa*）並びにそれによって感染するウイルス病；穀物、例えばコムギ又はオオムギに係るプソイドセルコスボレラ・ヘルボトリコイデス（*Pseudocercospora herpotrichoides*）（オクリマクラ・ヤルンダエ（*Oculimaculayallundae*）と同義、*O. acuformis*）：眼紋病、テレオモルフ：タペシア・ヤルンダエ（*Tapesia yallundae*））；様々な植物に係るプソイドペルノスポラ（*Pseudoperonospora*）（べと病）、例えばウリ科植物に係る*P. cubensis*又はホップに係る*P. humili*；ブドウに係るプソイドペツィクラ・トラケイフィラ（*Pseudopezizicola tracheiphila*）（赤色花火病又は「ロットブレンナー（rottbrenner）」、アナモルフ：フィアロフォラ（*Phialophora*））；様々な植物に係るプッチニア種（*Puccinia*）（さび病）、例えば、コムギ、オオムギ又はライムギなどの、穀物に係る*P. tritici*（褐色さび病又は葉さび病）、*P. striiformis*（縞さび病又は黄さび病）、*P. hordei*（矮化さび病）、*P. graminis*（茎さび病又は黒さび病）又は*P. recondita*（褐色さび病又は葉さび病）、サトウキビに係る*P. kuehni*（オレンジ色さび病）及びアスパラガスに係る*P. asparagi*；ナタネに係るピレノペジザ種（*Pyrenopeziza*）、例えば*P. brassicae*；コムギに係るピレノフォラ（*Pyrenophora*）（アナモルフ：ドレシュレラ（*Drechslera*））・トリチシーレペンチス（*tritici-repentis*）（黄褐色斑病）又はオオムギに係る*P. teres*（網斑病）；ピリクラリア種（*Pyricularia*）、例えばイネに係る*P. oryzae*（テレオモルフ：マグナポルテ・グリセア（*Magnaporthe grisea*）：イネイモチ病）並びにシバ

10

20

30

40

50

及び穀物に係る *P. グリセア* (*P. grisea*) ; シバ、イネ、トウモロコシ、コムギ、ワタ、ナタネ、ヒマワリ、ダイズ、テンサイ、野菜及び様々な他の植物に係る *Pythium* (苗立ち枯れ病) (例えば、*P. ウルティムム* (*P. ultimum*) 又は *P. アファニデルマトム* (*P. aphanidermatum*)) 及びマッシュルームに係る *P. オリガンドルム* (*P. oligandrum*) ; ラムラリア種 (*Ramularia*)、例えばオオムギに係る *R. コローシグニ* (*R. collo-cygni*) (ラムラリア葉斑点病、生理的葉斑点病)、ワタに係る *R. アレオラ* (*R. areola*) (テレモルフ: *ミコスフェレラ・アレオラ* (*Mycosphaerella areola*)) 及びテンサイに係る *R. ベチコラ* (*R. beticola*) ; ワタ、イネ、ジャガイモ、シバ、トウモロコシ、ナタネ、ジャガイモ、テンサイ、野菜及び様々な他の植物に係る *Rhizoctonia* 種 (例えばダイズに係る *R. ソラニ* (*R. solani*) (根及び茎腐れ病)、イネに係る *R. ソラニ* (*R. solani*) (紋枯病) 又はコムギ若しくはオオムギに係る *R. セレアリス* (*R. cerealis*) (リゾクトニア春枯れ病) ; イチゴ、ニンジン、キャベツ、ブドウ及びトマトに係る *Rhizopus stolonifer* (黒かび病、軟腐れ病) ; オオムギ、ライムギ及びライコムギに係る *Rhynchosporium secalis* 及び *R. コムネ* (*R. commune*) (火傷病) ; イネに係る *Sarocladium oryzae* 及び *S. アテヌアツム* (*S. attenuatum*) (鞘腐れ病) ; 野菜 (*S. ミノール* (*S. minor*) 及び *S. スクレロチオルム* (*S. sclerotiorum*)) 並びにナタネ、ヒマワリ (例えば、*S. スクレロチオルム*) 及びダイズなどの、農作物に係る *Sclerotinia* 種 (*Sclerotinia*) (茎腐れ病又は白かび病)、ダイズ、ラッカセイ、野菜、トウモロコシ、穀物及び観賞植物に係る *S. ロルフシイ* (*S. rolfii*) ; (*アテリア・ロルフシイ* (*Athelia rolfii*) と同義) ; 様々な植物に係る *Septoria* 種 (例えばダイズに係る *S. グリシネス* (*S. glycines*) (褐色斑病)、コムギに係る *S. トリチシ* (*S. tritici*) (コムギ葉枯病菌 (*Zymoseptoria tritici*) と同義、セプトリア斑点病) 及び穀物に係る *S. (スタゴノスポラ* (*Stagonospora*) と同義) *ノドルム* (*nodorum*) (スタゴノスポラ斑点病) ; ブドウに係る *Uncinula* (エリシフェ (*Erysiphe*) と同義) ・*ネカトル* (*necator*) (ウドンコ病、アナモルフ: *オイジウム・ツッケリ* (*Oidium tuckeri*)) ; トウモロコシ (例えば、*S. ツルシクム* (*S. turcicum*)、ヘルミントスポリウム・*ツルシクム* (*Helminthosporium turcicum*) と同義) 及びシバに係る *Setosphaeria* 種 (*Setosphaeria*) (黒葉枯病) ; トウモロコシ (例えば、*S. レイリアナ* (*S. reiliana*) : *ウスチラゴ・レイリアナ* (*Ustilago reiliana*) と同義: 黒穂病)、ソルガム及びサトウキビに係る *Sphaerellotheca* 種 (*Sphaerellotheca*) (すす病) ;

ウリ科植物に係る *Sphaerotheca fuliginea* (ポドスファエラ・*キサランチイ* (*Podosphaera xanthii*) と同義: ウドンコ病) ; ジャガイモに係る *Spongopora subterranea* (粉状瘡癰病) 及びそれによって感染するウイルス病 ; 穀物に係る *Stagonospora* 種 (例えばコムギに係る *S. ノドルム* (*S. nodorum*) (スタゴノスポラ斑点病、テレオモルフ: *レプトスファエリア* [*フェオスファエリア* (*Phaeosphaeria*) と同義] ・*ノドルム* (*nodorum*)、セプトリア・*ノドルム* (*Septoria nodorum*) と同義) ; ジャガイモに係る *Synchytrium endobioticum* (ジャガイモいぼ病) ; タフリナ種 (*Taphrina*)、例えばモモに係る *T. デフォルマンズ* (*T. deformans*) (縮葉病) 及びプラムに係る *T. プルニ* (*T. pruni*) (プラムポケット) ; タバコ、ナシ状果、野菜、ダイズ及びワタに係る *Thielaviopsis* 種 (*Thielaviopsis*) (黒根腐れ病)、例え

10

20

30

40

50

ば *T. basicola* (カララ・エレガンス (*Chalara elegans*) と同義) ; 穀物に係るチレチア種 (*Tilletia*) (一般黒穂病又は黒穂病)、例えばコムギに係る *T. tritici* (*T. caries*) と同義、コムギ黒穂病) 及び *T. controversa* (矮化黒穂病) ; マッシュルームに係るトリコデルマ・ハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*) ; オオムギ又はコムギに係るチフラ・インカルナタ (*Typhula incarnata*) (灰色雪かび病) ; ウロシスチス種 (*Urocystis*)、例えばライムギに係る *U. occulta* (縞すす病) ; マメ類 (例えば、*U. appendiculatus*)、*U. phaseoli* と同義)、テンサイ (例えば、*U. betae*) 又は *U. beticola*) などの、野菜に係る並びにマメ科植物 (例えば、*U. vignae*)、*U. pisi*)、*U. viciae-fabae*) 及び *U. fabae*) に係るウロマイセス種 (*Uromyces*) (さび病) ; 穀物 (例えば、*U. nuda*) 及び *U. avenae*)、トウモロコシ (例えば、*U. maydis*) : トウモロコシすす病) 及びサトウキビに係るウスチラゴ種 (*Ustilago*) (裸黒穂病) ; リンゴ (例えば、*V. inaequalis*) 及びナシに係るベンチュリア種 (*Venturia*) (黒星病) ; 並びに果物及び観賞植物、ブドウ、ソフトフルーツ、野菜及び農作物などの、様々な植物に係るバーティシリウム種 (*Verticillium*) (立ち枯れ病)、例えばナタネに係る *V. longisporum*、イチゴ、ナタネ、ジャガイモ及びトマトに係る *V. dahliae* 並びにマッシュルームに係る *V. fungicola* ; 穀物に係るコムギ葉枯病菌 (*Zymoseptoria tritici*)・トリチシ。

10

20

30

40

【0171】

化合物 I 及びその組成物は、それぞれ、以下の植物病害の病因の防除に特に好適である : ダイズ及び穀物に係るサビ病 (例えば、ダイズに係るファコプソラ・パキリジ (*Phakopsora pachyrhizi*) 及び *P. meibomia*) ; コムギに係るプシニア・トリチシナ (*Puccinia tritici*) 及び *P. striiformis*) ; 特殊農作物、ダイズ、ナタネ及びヒマワリに係るカビ病 (例えば、イチゴ及びブドウに係るボトリティス・シネレア (*Botrytis cinerea*)、ナタネ、ヒマワリ及びダイズに係る菌核病菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*)、*S. minor*) 及び *S. rolfsii*) ; 穀物に係るフザリウム病 (例えば、コムギに係るフザリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*) 及び *F. graminearum*) ; 特殊農作物に係るベト病 (例えば、ブドウに係るプラズモパマ・ビチコラ (*Plasmopara viticola*)、ジャガイモに係るフィトフトラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*) ; 特殊農作物及び穀物に係るウドンコ病 (例えば、ブドウに係るウンシヌラ・ネカトル (*Uncinula necator*)、様々な特殊農作物に係るエリシフェ属 (*Erysiphe* spp.)、穀物に係るブルメリア・グラミニス (*Blumeria graminis*) ; 並びに穀物、ダイズ及びトウモロコシに係る葉斑病 (例えば、穀物に係るセプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) 及び *S. nodorum*)、ダイズに係る *S. glycines*)、トウモロコシ及びダイズに係るセルコスポラ属 (*Cercospora* spp.))。

【0172】

化合物 I 及びその組成物は、それぞれ、貯蔵産物又は収穫物の保護及び材料の保護における有害微生物の防除にも好適である。

【0173】

「貯蔵産物又は収穫物」という用語は、長期間の保護が望まれる植物又は動物由来の天

50

然物質及びそれらの加工形態を意味すると理解される。植物由来の貯蔵産物、例えば茎、葉、塊茎、種子、果実又は穀粒は、収穫したての状態で又はそのプロセスが収穫後処理としても知られる、予備乾燥、湿潤、粉碎、細碎、圧搾、焙煎などの加工形態で保護することができる。貯蔵産物の定義に該当するものは、また、建設用木材、送電塔及びバリアなどの、粗木材の形態での、又は木材で製造された家具若しくはオブジェなどの、完成品の形態での木材でもある。動物由来の貯蔵産物は、皮革、レザー、ファー、毛などである。好ましくは、「貯蔵産物」は、植物由来の天然物質及びそれらの加工形態、より好ましくは果実及びそれらの加工形態、例えば果実、石果、ソフトフルーツ及び柑橘類並びにそれらの加工形態を意味すると理解され、ここで、化合物Ⅰ及びその組成物の適用は、腐敗、変色又はカビなどの不利な影響も防止することができる。

10

【0174】

「材料の保護」という用語は、接着剤、糊、木材、紙、板紙、織物、レザー、塗料分散液、プラスチック、冷却潤滑剤、繊維又は布などの、技術的及び非生物的材料の、真菌及び細菌などの有害微生物による侵入及び破壊からの保護を意味すると理解される。

【0175】

材料又は貯蔵生産物の保護に使用する場合、活性物質の施用量は、施用分野の種類に及び所望の効果に依存する。材料の保護における習慣的な施用量は、被処理材料の1立方メートル当たり0.001g～2kg、好ましくは0.005g～1kgの活性物質である。

【0176】

化合物Ⅰ及びその組成物は、それぞれ、植物の健康を改善するために使用され得る。本発明は、植物、その繁殖材料及び／又は植物が生育しているか若しくは生育しようとする場所を、それぞれ、有効量の化合物Ⅰ及びその組成物で処理することによって、植物の健康を改善する方法にも関する。

20

【0177】

「植物の健康」という用語は、収量（例えば、バイオマスの増加及び／又は貴重な成分の含有量の増加）、植物の活力（例えば、植物の成長の改善及び／又は葉の緑色化（「緑化効果」））、品質（例えば、特定の成分の含有量又は組成の改善）、並びに非生物のストレス及び／又は生物学的ストレスに対する耐性などの、幾つかの指標単独又は互いの組合せによって決定される植物及び／又はその産物の状態を意味すると理解される。植物の健康状態に関する上記の特定された指標は、相互に依存し得るか又は互いに起因し得る。

30

【0178】

化合物Ⅰは、真菌、植物、種子などの植物繁殖材料；真菌の攻撃から保護されるべき土壌、表面、材料又は部屋を殺菌有効量の活性物質で処理することにより、そのまま又は組成物の形態で利用される。施用は、植物、種子などの植物繁殖材料；土壌、表面、材料又は部屋の真菌による感染前及び感染後の両方で実施することができる。

【0179】

農薬組成物は、殺菌有効量の化合物Ⅰを含む。「殺菌有効量」という用語は、栽培植物に係る有害な真菌を防除するのに十分であるか、又は貯蔵産物若しくは収穫物の又は材料の保護に十分である、且つ処理された植物、処理された貯蔵産物若しくは収穫物に、又は処理された材料に実質的な損傷をもたらさない、組成物の又は化合物Ⅰの量を意味する。そのような量は、広い範囲で変わり得、防除すべき菌種、処理される栽培植物、貯蔵産物、収穫物若しくは材料、気候条件及び使用される具体的な化合物Ⅰなどの、様々な因子に依存する。

40

【0180】

植物繁殖材料は、植え付け若しくは移植時にか、又はその前のいずれかに化合物Ⅰそのまま又は少なくとも1種の化合物Ⅰを含む組成物で予防的に処理され得る。

【0181】

植物の防疫に用いられる場合、適用される活性物質の量は、所望の効果の種類に応じて、0.001～2kg／ha、好ましくは0.005～2kg／ha、より好ましくは0

50

． 05 ～ 0.9 kg / ha、特に 0.1 ～ 0.75 kg / ha である。

【0182】

例えば、散粉、コーティング又はドレンチングによる、種子などの植物繁殖材料の処理において、植物繁殖材料（好ましくは種子）の 100 kg 当たり、一般に 0.1 ～ 1000 g、好ましくは 1 ～ 1000 g、より好ましくは 1 ～ 100 g、最も好ましくは 5 ～ 100 g の量の活性物質が必要とされる。

【0183】

使用者は、通常、事前に用量を設定できるデバイス、背負い式噴霧器、噴霧タンク、噴霧飛行機、又は灌漑システムから農薬組成物を施用する。通常、農薬組成物は、水、緩衝剤、及び／又は更なる助剤で所望の施用濃度にメークアップされ、このようにして本発明による直ちに使用できる噴霧液又は農薬組成物が得られる。通常、20 ～ 2000 リットル、好ましくは 50 ～ 400 リットルの直ちに使用できる噴霧液が、農学的有用面積の 1 ヘクタール当たり施用される。

10

【0184】

化合物 I、それらの N-オキシド及び塩は、慣用的なタイプの農薬組成物、例えば溶液、乳剤、懸濁液、ダスト剤、粉剤、ペースト、粒剤、プレス剤、カプセル剤、及びそれらの混合物に変換することができる。組成物タイプの例（「Catalogue of pesticide formulation types and international coding system」, Technical Monograph No. 2, 6th Ed. May 2008, CropLife International も参照されたい）は、懸濁液（例えば、SC、OD、FS）、乳化性濃縮物（例えば、EC）、乳剤（例えば、EW、EO、ES、ME）、カプセル剤（例えば、CS、ZC）、ペースト、パステュー、水和剤又はダスト剤（例えば、WP、SP、WS、DP、DS）、プレス剤（例えば、BR、TB、DT）、粒剤（例えば、WG、SG、GR、FG、GG、MG）、殺虫物品（例えば、LN）、並びに種子などの植物繁殖材料の処理のためのゲル製剤（例えば、GF）である。組成物は、例えば、Mollet and Grubemann, Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001 によって；又は Knowles, New developments in crop protection product formulation, Agrow Reports DS243, T&F Informa, London, 2005 によって記載されるような、公知の方法で調製される。本発明は、補助剤及び少なくとも 1 種の化合物 I を含む農薬組成物にも関する。

20

30

【0185】

好適な助剤は、溶剤、液体担体、固体担体又は充填剤、界面活性剤、分散剤、乳化剤、湿潤剤、アジュバント、可溶化剤、浸透促進剤、保護コロイド、付着剤、増粘剤、保湿剤、忌避剤、誘引剤、摂食刺激物質、相溶化剤、殺菌剤、不凍剤、消泡剤、着色剤、粘着付与剤、及びバインダーである。

【0186】

好適な溶剤及び液体担体は、水及び有機溶剤、例えば中～高沸点の鉱油留分、例えばケロシン、ディーゼル油；植物又は動物由来の油；脂肪族、環式及び芳香族炭化水素、例えばトルエン、パラフィン、テトラヒドロナフタレン、及びアルキル化ナフタレン；アルコール類、例えばエタノール、プロパノール、ブタノール、ベンジルアルコール、シクロヘキサノール、グリコール；DMSO；ケトン類、例えばシクロヘキサノン；エステル類、例えば乳酸エステル、炭酸エステル、脂肪酸エステル、ガンマーブチロラクトン；脂肪酸類；ホスホネート類；アミン類；アミド、例えば N-メチルピロリドン、脂肪酸ジメチルアミド；並びにそれらの混合物である。

40

【0187】

好適な固体担体又は充填剤は、鉱物質土、例えばシリケート、シリカゲル、タルク、カオリン、石灰石、石灰、白亜、粘土、苦灰石、珪藻土、ベントナイト、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウム；多糖類、例えばセルロース、デンプン；肥料、例

50

例えば硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素；植物由来の製品、例えば穀物粗びき粉、樹皮粗びき粉、木材粗びき粉、堅果殻粗びき粉及びそれらの混合物である。

【0188】

好適な界面活性剤は、アニオン性、カチオン性、非イオン性及び両性界面活性剤、ブロックポリマー、高分子電解質、並びにそれらの混合物のような、界面活性化合物である。そのような界面活性剤は、乳化剤、分散剤、可溶化剤、湿潤剤、浸透促進剤、保護コロイド、又はアジュバントとして使用することができる。界面活性剤の例は、McCutcheon's, Vol. 1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008 (International Ed. 又は North American Ed.) に

10

【0189】

好適なアニオン性界面活性剤は、スルホネート、サルフェート、ホスフェート、カルボキシレート、及びそれらの混合物のアルカリ塩、アルカリ土類塩又はアンモニウム塩である。スルホネートの例は、アルキルアリールスルホネート、ジフェニルスルホネート、アルファオレフィンスルホネート、リグニンスルホネート、脂肪酸及び油のスルホネート、エトキシ化アルキルフェノールのスルホネート、アルコキシ化アリールフェノールのスルホネート、縮合ナフタレンのスルホネート、ドデシル-及びトリデシルベンゼンのスルホネート、ナフタレンの及びアルキルナフタレンのスルホネート、スルホスクシネート、又はスルホスクシナメートである。サルフェートの例は、脂肪酸の、油の、エトキシ化アルキルフェノールの、アルコールの、エトキシ化アルコールの、又は脂肪酸エステル

20

【0190】

好適な非イオン性界面活性剤は、アルコキシレート、N-置換脂肪酸アミド、アミノオキシド、エステル、糖系界面活性剤、高分子界面活性剤、及びそれらの混合物である。アルコキシレートの例は、1~50当量でアルコキシ化された、アルコール、アルキルフェノール、アミン、アミド、アリールフェノール、脂肪酸又は脂肪酸エステルなどの化合物である。アルコキシ化のために、エチレンオキシド及び／又はプロピレンオキシド、好ましくはエチレンオキシドを使用され得る。N-置換脂肪酸アミドの例は、脂肪酸グルカミド又は脂肪酸アルカノールアミドである。エステルの例は、脂肪酸エステル、グリセロールエステル、又はモノグリセリドである。糖系界面活性剤の例は、ソルビタン、エトキシ化ソルビタン、スクロース及びグルコースエステル、又はアルキルポリグルコシドである。高分子界面活性剤の例は、ビニルピロリドン、ビニルアルコール、又は酢酸ビニルのホモポリマー又はコポリマーである。

30

【0191】

好適なカチオン性界面活性剤は、四級界面活性剤、例えば1つ又は2つの疎水基を持った四級アンモニウム化合物、又は長鎖一級アミンの塩である。好適な両性界面活性剤は、アルキルベタイン及びイミダゾリンである。好適なブロックポリマーは、ポリエチレンオキシド及びポリプロピレンオキシドのブロックを含むA-B若しくはA-B-Aタイプの、又はアルカノール、ポリエチレンオキシド、及びポリプロピレンオキシドを含むA-B-Cタイプのブロックポリマーである。好適な高分子電解質は、ポリ酸又はポリ塩基である。ポリ酸の例は、ポリアクリル酸のアルカリ塩又はポリ酸型ポリマーである。ポリ塩基の例は、ポリビニルアミン又はポリエチレンアミンである。

40

【0192】

好適なアジュバントは、それら自体無視できるか又は全くない殺虫活性を有する、及び標的に対する化合物Iの生物学的性能を向上させる、化合物である。例は、界面活性剤、鉱油又は植物油、及び他の助剤である。更なる例は、Knowles, Adjuvant

50

s and additives, Agrow Reports DS256, T & F Informa UK, 2006, chapter 5 に列挙されている。好適な増粘剤は、多糖類（例えば、キサンタンガム、カルボキシメチルセルロース）、無機粘土（有機修飾又は非修飾）、ポリカルボキシレート、及びシリケートである。

【0193】

好適な殺菌剤は、プロノポール及びイソチアゾリノン誘導体、例えばアルキルイソチアゾリノン及びベンズイソチアゾリノンなどである。好適な不凍剤は、エチレングリコール、プロピレングリコール、尿素及びグリセリンである。

【0194】

好適な消泡剤は、シリコーン、長鎖アルコール、及び脂肪酸の塩である。

10

【0195】

好適な着色剤（例えば、赤、青又は緑色の）は、低い水溶性の顔料及び水溶性染料である。例は、無機着色剤（例えば、酸化鉄、酸化チタン、ヘキサシアノ鉄酸鉄）及び有機着色剤（例えば、アリザリン着色剤、アゾ着色剤及びフタロシアニン着色剤）である。

【0196】

好適な粘着性付与剤又はバインダーは、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、ポリアクリレート、生物ワックス又は合成ワックス、及びセルロースエーテルである。

【0197】

農薬組成物は、一般に、0.01～95重量%、好ましくは0.1～90重量%、より好ましくは1～70重量%、特に10～60重量%の活性物質（例えば、少なくとも1種の化合物Ⅰ）を含む。農薬組成物は、一般に、5～99.9重量%、好ましくは10～99.9重量%、より好ましくは30～99重量%、特に40～90重量%の少なくとも1種の補助剤を含む。活性物質（例えば、化合物Ⅰ）は、90%～100%、好ましくは95%～100%の純度（NMRスペクトルによる）で使用される。

20

【0198】

植物繁殖材料、特に種子の処理を目的として、種子処理用溶液（LS）、サスポエマルジョン（SE）、流動性濃縮物（FS）、乾燥処理用粉末（DS）、スラリー処理用水分散性粉末（WS）、水溶性粉末（SS）、乳剤（ES）、乳化性濃縮物（EC）、及びゲル（GF）が通常用いられる。対象の組成物は、2～10倍希釈後に、直ちに使用できる製剤において、0.01～60重量%、好ましくは0.1～40%の活性物質濃度を与える。施用は、播種前又は播種中に実施することできる。化合物Ⅰ及びその組成物を、それぞれ、植物繁殖材料、とりわけ種子に適用する方法としては、粉衣、コーティング、ペレット化、散粉、浸漬、並びに播種内適用法が挙げられる。好ましくは、化合物Ⅰ又はその組成物は、それぞれ、出芽が誘導されないような方法によって、例えば種子粉衣、ペレット化、コーティング、及び散粉によって植物繁殖材料に施用される。

30

【0199】

様々なタイプの油剤、湿潤剤、アジュバント、肥料、又は微量栄養素、及び更なる農薬（例えば、殺真菌剤、成長調節剤、除草剤、殺虫剤、緩和剤）が、プレミックスとして化合物Ⅰ又はその組成物に添加されても、又は、使用直前（タンクミックス）まで添加されなくてもよい。これらの薬剤は、本発明による組成物と1：100～100：1、好ましくは1：10～10：1の重量比で混合することができる。

40

【0200】

殺有害生物剤は、一般に、その効果によって有害生物を抑止、無力化、死滅又は他の方法で駆除する化学的又は生物学的薬剤（殺有害生物活性成分、化合物、組成物、ウイルス、細菌、抗菌剤、又は殺菌剤など）である。標的有害生物には、昆虫、植物病原菌、雑草、軟体動物、鳥類、哺乳類、魚類、線虫（回虫）、及び財産を破壊するか、不快を引き起こすか、病気を蔓延させるか又は病気の媒介となる微生物が含まれる。「殺有害生物剤」という用語には、植物の期待される成長、開花、又は繁殖速度を変化させる植物成長調節剤；通常収穫を容易にするために、植物から葉又は他の枝葉を落下させる落葉剤；不要な

50

植物頂部などの、生体組織の乾燥を促進する乾燥剤；特定の有害生物からの防御のための植物生理を活性化させる植物活性剤；作物植物への殺有害生物剤の望ましくない除草作用を軽減する解毒剤；並びに例えば、植物の成長、バイオマス、収量又は作物植物の収穫可能な産物の任意の他の品質パラメータを増加させるために植物生理に影響を与える植物成長促進剤も含まれる。

【0201】

バイオ殺有害生物剤は、微生物（細菌、真菌、ウイルス、線虫等）又は天然産物（代謝物質、タンパク質、又は生物源若しくは他の天然源からの抽出物などの、化合物）に基づく殺有害生物剤の形態と定義されている（米国環境保護庁：<http://www.epa.gov/pesticides/biopesticides/>）。バイオ殺有害生物剤は、2つの主要なクラス、微生物殺有害生物剤及び生化学的殺有害生物剤に分かれる；

10

（１）微生物殺有害生物剤は、細菌、真菌又はウイルスからなる（且つ多くの場合、細菌及び真菌が生成する代謝産物を含む）。昆虫病原性線虫も、多細胞性であるが、微生物殺有害生物剤に分類される。

（２）生化学的殺有害生物剤は、有害生物を防除するか、又は以下に定義されるような他の作物保護用途を提供する天然由来の物質であるが、哺乳類には比較的無毒である。

【0202】

殺真菌剤としての使用形態にある化合物Ⅰ又はそれらを含む組成物を他の殺真菌剤と混合すると、多くの場合に、活性の殺真菌スペクトルの拡大を又は殺真菌剤耐性発現の防止をもたらす。更に、多くの場合に、相乗効果が得られる（相乗混合物）。

20

【0203】

化合物Ⅰと併用することができる、殺有害生物剤ⅠⅠの以下のリストは、可能な組合せを例示することを意図しているが、それらを限定するものではない：

A) 呼吸阻害剤

ー Q。部位における複合体ⅠⅠⅠの阻害剤：アゾキシストロビン（A. 1. 1）、クメトキシストロビン（A. 1. 2）、クモキシストロビン（A. 1. 3）、ジモキシストロビン（A. 1. 4）、エネストロブリン（A. 1. 5）、フェナミンストロビン（A. 1. 6）、フェノキシストロビン／フルフェノキシストロビン（A. 1. 7）、フルオキサストロビン（A. 1. 8）、クレソキシム－メチル（A. 1. 9）、マンドエストロビン（A. 1. 10）、メトミノストロビン（A. 1. 11）、オリサストロビン（A. 1. 12）、ピコキシストロビン（A. 1. 13）、ピラクロストロビン（A. 1. 14）、ピラメトストロビン（A. 1. 15）、ピラオキシストロビン（A. 1. 16）、トリフロキシストロビン（A. 1. 17）、2－（2－（3－（2，6－ジクロロフェニル）－1－メチル－アリリデンアミノオキシメチル）－フェニル）－2－メトキシイミノ－N－メチル－アセトアミド（A. 1. 18）、ピリベンカルブ（A. 1. 19）、トリクロピリカルブ／クロロジンカルブ（A. 1. 20）、ファモクサドン（A. 1. 21）、フェナミドン（A. 1. 21）、メチル－N－〔2－〔（1，4－ジメチル－5－フェニル－ピラゾール－3－イル）オキシメチル〕フェニル〕－N－メトキシ－カルバメート（A. 1. 22）、メチルテトラプロール（A. 1. 25）、（Z，2E）－5－〔1－（2，4－ジクロロフェニル）ピラゾール－3－イル〕－オキシ－2－メトキシイミノ－N，3－ジメチル－ペント－3－エンアミド（A. 1. 34）、（Z，2E）－5－〔1－（4－クロロフェニル）ピラゾール－3－イル〕オキシ－2－メトキシイミノ－N，3－ジメチル－ペント－3－エンアミド（A. 1. 35）、ピリミノストロビン（A. 1. 36）、ピフジュンチ（A. 1. 37）、2－（オルト－（（2，5－ジメチルフェニル－オキシメチレン）フェニル）－3－メトキシ－アクリル酸メチルエステル（A. 1. 38）；

30

40

ー Q_i 部位における複合体ⅠⅠⅠの阻害剤：シアゾファミド（A. 2. 1）、アミスルプロム（A. 2. 2）、〔（6S，7R，8R）－8－ベンジル－3－〔（3－ヒドロキシ－4－メトキシ－ピリジン－2－カルボニル）アミノ〕－6－メチル－4，9－ジオキ

50

ソー１，５－ジオキソナン－７－イル] ２－メチルプロパノエート（Ａ．２．３）、フェンピコキサミド（Ａ．２．４）、フロリルピコキサミド（Ａ．２．５）、メタリルピコキサミド（Ａ．２．６）；

－ 錯合体ⅠⅠの阻害剤：ベノダニル（Ａ．３．１）、ベンゾビンジフルビル（Ａ．３．２）、ピキサフェン（Ａ．３．３）、ボスカリド（Ａ．３．４）、カルボキシシン（Ａ．３．５）、フェンフラム（Ａ．３．６）、フルオピラム（Ａ．３．７）、フルトラニル（Ａ．３．８）、フルキサピロキサド（Ａ．３．９）、フラメトビル（Ａ．３．１０）、イソフェタミド（Ａ．３．１１）、イソピラザム（Ａ．３．１２）、メプロニル（Ａ．３．１３）、オキシカルボキシシン（Ａ．３．１４）、ペンフルフェン（Ａ．３．１５）、ペンチオピラド（Ａ．３．１６）、ピジフルメトフェン（Ａ．３．１７）、ピラジフルミド（Ａ．３．１８）、セダキサン（Ａ．３．１９）、テクロフタラム（Ａ．３．２０）、チフルザミド（Ａ．３．２１）、インビルフルキサム（Ａ．３．２２）、ピラプロポイン（Ａ．３．２３）、フルインダビル（Ａ．３．２８）、 N －[２－[２－クロロ－４－（トリフルオロメチル）フェノキシ]フェニル]－３－（ジフルオロメチル）－５－フルオロ－１－メチル－ピラゾール－４－カルボキサミド（Ａ．３．２９）、メチル（ E ）－２－[２－[（５－シアノ－２－メチル－フェノキシ）メチル]フェニル]－３－メトキシ－プロブ－２－エノエート（Ａ．３．３０）、イソフルシプラム（Ａ．３．３１）、２－（ジフルオロメチル）－ N －（１，１，３－トリメチル－インダン－４－イル）ピリジン－３－カルボキサミド（Ａ．３．３２）、２－（ジフルオロメチル）－ N －[（３ R ）－１，１，３－トリメチルインダン－４－イル]ピリジン－３－カルボキサミド（Ａ．３．３３）、２－（ジフルオロメチル）－ N －（３－エチル－１，１－ジメチル－インダン－４－イル）ピリジン－３－カルボキサミド（Ａ．３．３４）、２－（ジフルオロメチル）－ N －[（３ R ）－３－エチル－１，１－ジメチル－インダン－４－イル]ピリジン－３－カルボキサミド（Ａ．３．３５）、２－（ジフルオロメチル）－ N －（１，１－ジメチル－３－プロピル－インダン－４－イル）ピリジン－３－カルボキサミド（Ａ．３．３６）、２－（ジフルオロメチル）－ N －[（３ R ）－１，１－ジメチル－３－プロピル－インダン－４－イル]ピリジン－３－カルボキサミド（Ａ．３．３７）、２－（ジフルオロメチル）－ N －（３－イソブチル－１，１－ジメチル－インダン－４－イル）ピリジン－３－カルボキサミド（Ａ．３．３８）、２－（ジフルオロメチル）－ N －[（３ R ）－３－イソブチル－１，１－ジメチル－インダン－４－イル]ピリジン－３－カルボキサミド（Ａ．３．３９）シクロブトリフルラム（Ａ．３．２４）；

－ 他の呼吸阻害剤：ジフルメトリム（Ａ．４．１）；ニトロフェニル誘導体：ビナパクリル（Ａ．４．２）、ジノブトン（Ａ．４．３）、ジノキャップ（Ａ．４．４）、フルアジナム（Ａ．４．５）、メブチルジノキャップ（Ａ．４．６）、フェリムゾン（Ａ．４．７）；有機金属化合物：フェンチン塩、例えばフェンチンアセテート（Ａ．４．８）、フェンチンクロリド（Ａ．４．９）又はフェンチンヒドロキシド（Ａ．４．１０）；アメクトラジン（Ａ．４．１１）；シルチオファム（Ａ．４．１２）；

Ｂ）ステロール生合成阻害剤（ＳＢⅠ殺真菌剤）

－ $C14$ 脱メチラーゼ阻害剤：トリアゾール：アザコナゾール（Ｂ．１．１）、ビテルタノール（Ｂ．１．２）、プロムコナゾール（Ｂ．１．３）、シプロコナゾール（Ｂ．１．４）、ジフェノコナゾール（Ｂ．１．５）、ジニコナゾール（Ｂ．１．６）、ジニコナゾール－ M （Ｂ．１．７）、エポキシコナゾール（Ｂ．１．８）、フェンブコナゾール（Ｂ．１．９）、フルキンコナゾール（Ｂ．１．１０）、フルシラゾール（Ｂ．１．１１）、フルトリアホル（Ｂ．１．１２）、ヘキサコナゾール（Ｂ．１．１３）、イミベンコナゾール（Ｂ．１．１４）、イブコナゾール（Ｂ．１．１５）、メトコナゾール（Ｂ．１．１７）、ミクロブタニル（Ｂ．１．１８）、オキスポコナゾール（Ｂ．１．１９）、パクロブトラゾール（Ｂ．１．２０）、ペンコナゾール（Ｂ．１．２１）、プロピコナゾール（Ｂ．１．２２）、プロチオコナゾール（Ｂ．１．２３）、シメコナゾール（Ｂ．１．２４）、テブコナゾール（Ｂ．１．２５）、テトラコナゾール（Ｂ．１．２６）、トリアジメホン（Ｂ．１．２７）、トリアジメノール（Ｂ．１．２８）、トリチコナゾール（Ｂ

10

20

30

40

50

- . 1. 29)、ウニコナゾール (B. 1. 30)、2-(2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 1-ジフルオロ-3-(テトラゾール-1-イル)-1-[5-[4-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)フェニル]-2-ピリジル]プロパン-2-オール (B. 1. 31)、2-(2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 1-ジフルオロ-3-(テトラゾール-1-イル)-1-[5-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]-2-ピリジル]プロパン-2-オール (B. 1. 32)、4-[6-[2-(2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 1-ジフルオロ-2-ヒドロキシ-3-(5-スルファニル-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)プロピル]-3-ピリジル]オキシ]ベンゾニトリル (B. 1. 33)、イプフェントリフルコナゾール (B. 1. 37)、メフェントリフルコナゾール (B. 1. 38)、(2R)-2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール、(2S)-2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール、2-(クロロメチル)-2-メチル-5-(p-トリルメチル)-1-(1, 2, 4-トリアゾール-1-イルメチル)シクロペンタノール (B. 1. 43); イミダゾール: イマザリル (B. 1. 44)、ペフラゾエート (B. 1. 45)、プロクロラズ (B. 1. 46)、トリフルミゾール (B. 1. 47); ピリミジン、ピリジン、ピペラジン: フェナリモル (B. 1. 49)、ピリフェノクス (B. 1. 50)、トリホリン (B. 1. 51)、[3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-5-(2, 4-ジフルオロフェニル)イソオキサゾール4-イル]-3-ピリジル]メタノール (B. 1. 52)、4-[6-[2-(2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 1-ジフルオロ-2-ヒドロキシ-3-(1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)プロピル]-3-ピリジル]オキシ]ベンゾニトリル (B. 1. 53)、2-[6-(4-ブromoフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]-1-(1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール (B. 1. 54)、2-[6-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)-3-ピリジル]-1-(1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール (B. 1. 55);
- デルタ14-レダクターゼ阻害剤: アルジモルフ (B. 2. 1)、ドデモルフ (B. 2. 2)、ドデモルフ-アセテート (B. 2. 3)、フェンプロピモルフ (B. 2. 4)、トリデモルフ (B. 2. 5)、フェンプロピジン (B. 2. 6)、ピペラリン (B. 2. 7)、スピロキサミン (B. 2. 8);
- 3-ケトレダクターゼ阻害剤: フェンヘキサミド (B. 3. 1);
- 他のステロール生合成阻害剤: クロルフエノミゾール (B. 4. 1);
- C) 核酸合成阻害剤**
- フェニルアミド又はアシルアミノ酸殺真菌剤: ベナラキシル (C. 1. 1)、ベナラキシル-M (C. 1. 2)、キララキシル (C. 1. 3)、メタラキシル (C. 1. 4)、メタラキシル-M (C. 1. 5)、オフレース (C. 1. 6)、オキサジキシル (C. 1. 7);
- 他の核酸合成阻害剤: ヒメキサゾール (C. 2. 1)、オクチリノン (C. 2. 2)、オキソリン酸 (C. 2. 3)、ブピリメート (C. 2. 4)、5-フルオロシトシン (C. 2. 5)、5-フルオロ-2-(p-トリルメトキシ)ピリミジン-4-アミン (C. 2. 6)、5-フルオロ-2-(4-フルオロフェニルメトキシ)ピリミジン-4-アミン (C. 2. 7)、5-フルオロ-2-(4-クロロフェニルメトキシ)ピリミジン-4-アミン (C. 2. 8);
- D) 細胞分裂及び細胞骨格の阻害剤**
- チューブリン阻害剤: ベノミル (D. 1. 1)、カルベンダジム (D. 1. 2)、フベリダゾール (D. 1. 3)、チアベンダゾール (D. 1. 4)、チオファネート-メチル (D. 1. 5)、ピリダクロメチル (D. 1. 6)、N-エチル-2-[(3-エチニル-8-メチル-6-キノリル)オキシ]ブタンアミド (D. 1. 8)、N-エチル-2-[(3-エチニル-8-メチル-6-キノリル)オキシ]-2-メチルスルファニル-

アセトアミド (D. 1. 9)、2-[(3-エチニル-8-メチル-6-キノリル)オキシ]-N-(2-フルオロエチル)ブタンアミド (D. 1. 10)、2-[(3-エチニル-8-メチル-6-キノリル)オキシ]-N-(2-フルオロエチル)-2-メトキシ-アセトアミド (D. 1. 11)、2-[(3-エチニル-8-メチル-6-キノリル)オキシ]-N-プロピル-ブタンアミド (D. 1. 12)、2-[(3-エチニル-8-メチル-6-キノリル)オキシ]-2-メトキシ-N-プロピル-アセトアミド (D. 1. 13)、2-[(3-エチニル-8-メチル-6-キノリル)オキシ]-2-メチルスルファニル-N-プロピル-アセトアミド (D. 1. 14)、2-[(3-エチニル-8-メチル-6-キノリル)オキシ]-N-(2-フルオロエチル)-2-メチルスルファニル-アセトアミド (D. 1. 15)、4-(2-ブromo-4-フルオロ-フェニル)-N-(2-クロロ-6-フルオロ-フェニル)-2, 5-ジメチル-ピラゾール-3-アミン (D. 1. 16) ;

10

ー 他の細胞分裂阻害剤：ジエトフェンカルブ (D. 2. 1)、エタボキサム (D. 2. 2)、ペンシクロン (D. 2. 3)、フルオピコリド (D. 2. 4)、ゾキサミド (D. 2. 5)、メトラフェノン (D. 2. 6)、ピリオフェノン (D. 2. 7)、フェナマクリル (D. 2. 8) ;

E) アミノ酸及びタンパク質合成阻害剤

ー メチオニン合成阻害剤：シプロジニル (E. 1. 1)、メパニピリム (E. 1. 2)、ピリメタニル (E. 1. 3) ;

ー タンパク質合成阻害剤：ブラストサイジン-S (E. 2. 1)、カスガマイシン (E. 2. 2)、カスガマイシン塩酸塩-水和物 (E. 2. 3)、ミルジオマイシン (E. 2. 4)、ストレプトマイシン (E. 2. 5)、オキシテトラサイクリン (E. 2. 6) ;

20

F) シグナル伝達阻害剤

ー MAP/ヒスチジンキナーゼ阻害剤：フルオロイミド (F. 1. 1)、イプロジオン (F. 1. 2)、プロシミドン (F. 1. 3)、ピンクロゾリン (F. 1. 4)、フルジオキサニル (F. 1. 5) ;

ー Gタンパク質阻害剤：キノキシフェン (F. 2. 1) ;

G) 脂質及び膜合成阻害剤

ー リン脂質生合成阻害剤：エジフェンホス (G. 1. 1)、イプロベンホス (G. 1. 2)、ピラゾホス (G. 1. 3)、イソプロチオラン (G. 1. 4) ;

30

ー 脂質過酸化：ジクロラン (G. 2. 1)、キントゼン (G. 2. 2)、テクナゼン (G. 2. 3)、トルクロホス-メチル (G. 2. 4)、ピフェニル (G. 2. 5)、クロロネブ (G. 2. 6)、エトリジアゾール (G. 2. 7)、亜鉛チアゾール (G. 2. 8) ;

ー リン脂質の生合成及び細胞壁沈着：ジメトモルフ (G. 3. 1)、フルモルフ (G. 3. 2)、マンジプロパミド (G. 3. 3)、ピリモルフ (G. 3. 4)、ベンチアバリカルブ (G. 3. 5)、イプロバリカルブ (G. 3. 6)、バリフェナレート (G. 3. 7) ;

ー 細胞膜透過性及び脂肪酸に影響を及ぼす化合物：プロバモカルブ (G. 4. 1) ;

ー オキシステロール結合タンパク質の阻害剤：オキサチアピプロリン (G. 5. 1)、フルオキサピプロリン (G. 5. 3)、4-[1-[2-[3-(ジフルオロメチル)-5-メチル-ピラゾール-1-イル]アセチル]-4-ピペリジル]-N-テトラリン-1-イル-ピリジン-2-カルボキサミド (G. 5. 4)、4-[1-[2-[3, 5-ビス(ジフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]アセチル]-4-ピペリジル]-N-テトラリン-1-イル-ピリジン-2-カルボキサミド (G. 5. 5)、4-[1-[2-[3-(ジフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]アセチル]-4-ピペリジル]-N-テトラリン-1-イル-ピリジン-2-カルボキサミド (G. 5. 6)、4-[1-[2-[5-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]アセチル]-4-ピペリジル]-N-テトラリン-1-イル-ピリジン-2-カルボキサミド (G. 5. 7)、4-[1-[2-[5-メチル-3-(ト

40

50

リフルオロメチル) ピラゾール-1-イル] アセチル] -4-ピペリジル] -N-テトラリン-1-イル-ピリジン-2-カルボキサミド (G. 5. 8)、4-[1-[2-[5-(ジフルオロメチル)-3-(トリフルオロメチル) ピラゾール-1-イル] アセチル] -4-ピペリジル] -N-テトラリン-1-イル-ピリジン-2-カルボキサミド (G. 5. 9)、4-[1-[2-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル) ピラゾール-1-イル] アセチル] -4-ピペリジル] -N-テトラリン-1-イル-ピリジン-2-カルボキサミド (G. 5. 10)、(4-[1-[2-[5-シクロプロピル-3-(トリフルオロメチル) ピラゾール-1-イル] アセチル] -4-ピペリジル] -N-テトラリン-1-イル-ピリジン-2-カルボキサミド (G. 5. 11) ;

H) マルチサイト作用を持った阻害剤

ー 無機活性物質: ボルドー液 (H. 1. 1)、銅 (H. 1. 2)、酢酸銅 (H. 1. 3)、水酸化銅 (H. 1. 4)、オキシ塩化銅 (H. 1. 5)、塩基性硫酸銅 (H. 1. 6)、硫黄 (H. 1. 7) ;

ー チオ-及びジチオカルバメート: フェルバム (H. 2. 1)、マンコゼブ (H. 2. 2)、マネブ (H. 2. 3)、メタム (H. 2. 4)、メチラム (H. 2. 5)、プロピネブ (H. 2. 6)、チラム (H. 2. 7)、ジネブ (H. 2. 8)、ジラム (H. 2. 9) ;

ー 有機塩素化合物: アニラジン (H. 3. 1)、クロロタロニル (H. 3. 2)、カプタホール (H. 3. 3)、カプタン (H. 3. 4)、ホルベット (H. 3. 5)、ジクロフルアニド (H. 3. 6)、ジクロロフェン (H. 3. 7)、ヘキサクロロベンゼン (H. 3. 8)、ペンタクロロフェノール (H. 3. 9) 及びその塩、フタリド (H. 3. 10)、トリルフルアニド (H. 3. 11) ;

ー グアニジン及びその他: グアニジン (H. 4. 1)、ドジン (H. 4. 2)、ドジン遊離塩基 (H. 4. 3)、グアザチン (H. 4. 4)、グアザチン-アセテート (H. 4. 5)、イミノオクタジン (H. 4. 6)、イミノオクタジン-トリアセテート (H. 4. 7)、イミノオクタジン-トリス(アルベシレート) (H. 4. 8)、ジチアノン (H. 4. 9)、2, 6-ジメチル-1H, 5H-[1, 4]ジチイノ[2, 3-c: 5, 6-c']ジピロール-1, 3, 5, 7(2H, 6H)-テトラオン (H. 4. 10) ;

I) 細胞壁合成阻害剤

ー グルカン合成の阻害剤: バリダマイシン (I. 1. 1)、ポリオキシシンB (I. 1. 2) ;

ー メラニン合成阻害剤: ピロキロン (I. 2. 1)、トリシクラゾール (I. 2. 2)、カルプロパミド (I. 2. 3)、ジシクロメット (I. 2. 4)、フェノキサニル (I. 2. 5) ;

J) 植物防御誘導剤

ー アシベンゾラル-S-メチル (J. 1. 1)、プロベナゾール (J. 1. 2)、イソチアニル (J. 1. 3)、チアジニル (J. 1. 4)、プロヘキサジオン-カルシウム (J. 1. 5) ; ホスホネート: ホセチル (J. 1. 6)、ホセチル-アルミニウム (J. 1. 7)、亜リン酸及びその塩 (J. 1. 8)、ホスホン酸カルシウム (J. 1. 11)、ホスホン酸カリウム (J. 1. 12)、重炭酸カリウム又はナトリウム (J. 1. 9)、4-シクロプロピル-N-(2, 4-ジメトキシフェニル)チアジアゾール-5-カルボキサミド (J. 1. 10) ;

K) 作用機序不明

ー ブロノポール (K. 1. 1)、キノメチオナート (K. 1. 2)、シフルフェナミド (K. 1. 3)、シモキサニル (K. 1. 4)、ダゾメット (K. 1. 5)、デバカルブ (K. 1. 6)、ジクロシメット (K. 1. 7)、ジクロメジン (K. 1. 8)、ジフェンゾクワット (K. 1. 9)、ジフェンゾクワット-メチルサルフェート (K. 1. 10)、ジフェニルアミン (K. 1. 11)、フェニトロパン (K. 1. 12)、フェンピラザミン (K. 1. 13)、フルメトバー (K. 1. 14)、フルスルファミド (K. 1. 15)、フルチアニル (K. 1. 16)、ハルピン (K. 1. 17)、メタスルホカルブ

10

20

30

40

50

(K. 1. 18)、ニトラピリン(K. 1. 19)、ニトロタルーイソプロピル(K. 1. 20)、トルプロカルブ(K. 1. 21)、オキシシン銅(K. 1. 22)、プロキナジド(K. 1. 23)、テブフロキン(K. 1. 24)、テクロフタラム(K. 1. 25)、トリアゾキシド(K. 1. 26)、N'-(4-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン(K. 1. 27)、N'-(4-(4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン(K. 1. 28)、N'-[4-[3-[(4-クロロフェニル)メチル]-1,2,4-チアジアゾール-5-イル]オキシ]-2,5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン(K. 1. 29)、N'-(5-ブromo-6-インダン-2-イルオキシ-2-メチル-3-ピリジル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン(K. 1. 30)、N'-[5-ブromo-6-[1-(3,5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチル-3-ピリジル]-N-エチル-N-メチルホルムアミジン(K. 1. 31)、N'-[5-ブromo-6-(4-イソプロピルシクロヘキソキシ)-2-メチル-3-ピリジル]-N-エチル-N-メチルホルムアミジン(K. 1. 32)、N'-[5-ブromo-2-メチル-6-(1-フェニルエトキシ)-3-ピリジル]-N-エチル-N-メチルホルムアミジン(K. 1. 33)、N'-(2-メチル-5-トリフルオロメチル-4-(3-トリメチルシラニルプロポキシ)-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン(K. 1. 34)、N'-(5-ジフルオロメチル-2-メチル-4-(3-トリメチルシラニルプロポキシ)-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン(K. 1. 35)、2-(4-クロロフェニル)-N-[4-(3,4-ジメトキシフェニル)-イソオキサゾール5-イル]-2-プロパ-2-イニルオキシアセトアミド(K. 1. 36)、3-[5-(4-クロロフェニル)-2,3-ジメチル-イソオキサゾリジン-3-イル]-ピリジン(ピリソキサゾール)(K. 1. 37)、3-[5-(4-メチルフェニル)-2,3-ジメチル-イソオキサゾリジン-3-イル]-ピリジン(K. 1. 38)、5-クロロ-1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-2-メチル-1H-ベンゾイミダゾール(K. 1. 39)、エチル(Z)-3-アミノ-2-シアノ-3-フェニルプロパ-2-エノエート(K. 1. 40)、ピカルブトラゾクス(K. 1. 41)、ペンチル N-[6-[[(Z)-[1-メチルテトラゾール-5-イル]-フェニルメチレン]アミノ]オキシメチル]-2-ピリジルカルバメート(K. 1. 42)、ブタ-3-イニル N-[6-[[(Z)-[1-メチルテトラゾール-5-イル]-フェニルメチレン]アミノ]オキシメチル]-2-ピリジルカルバメート(K. 1. 43)、イプフルフェノキン(K. 1. 44)、キノフメリン(K. 1. 47)、ベンジオチアゾリノン(K. 1. 48)、ブromotaronil(K. 1. 49)、2-(6-ベンジル-2-ピリジル)キナゾリン(K. 1. 50)、2-[6-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-5-メチル-2-ピリジル]キナゾリン(K. 1. 51)、ジクロベンチアゾクス(K. 1. 52)、N'-(2,5-ジメチル-4-フェノキシフェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン(K. 1. 53)、アミノピリフェン(K. 1. 54)、フルオピモミド(K. 1. 55)、N'-[5-ブromo-2-メチル-6-(1-メチル-2-プロポキシエトキシ)-3-ピリジル]-N-エチル-N-メチルホルムアミジン(K. 1. 56)、N'-[4-(4,5-ジクロロチアゾール-2-イル)オキシ-2,5-ジメチルフェニル]-N-エチル-N-メチルホルムアミジン(K. 1. 57)、N-(2-フルオロフェニル)-4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]ベンズアミド(K. 1. 58)、N-メチル-4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]ベンゼンカルボチオアミド(K. 1. 59)、N-メトキシ-N-[4-[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル]フェニル]メチルシクロプロパンカルボキサミド(国際公開第2018/177894号パンフレット、国際公開第2020/212513号パンフレット)；

10

20

30

40

50

L) バイオ殺有害生物剤

L1) 殺真菌活性、殺細菌活性、殺ウイルス活性及び／又は植物防御活性剤活性を持った微生物殺有害生物剤：アンペロマイセス・クイスクアリス (*Ampelomyces quisqualis*)、アスペルギルス・フラバス (*Aspergillus flavus*)、オーレオバシディウム・プルランス (*Aureobasidium pullulans*)、バチルス・アルティテュディニス (*Bacillus altitudinis*)、B. アミロリクエファシエンス (*B. amyloliquefaciens*)、B. アミロリクエファシエンス亜種プランタルム (*B. amyloliquefaciens ssp. plantarum*) (B. ヴェレゼンシス (*B. velezensis*) とも言われる)、B. メガテリウム (*B. megaterium*)、B. モジャベンシス (*B. mojavensis*)、B. マイコイデス (*B. mycoides*)、B. プミルス (*B. pumilus*)、B. シンプレックス (*B. simplex*)、B. ソリサルシ (*B. solisalsi*)、B. サブチリス (*B. subtilis*)、B. サブチリス変種アミロリクエファシエンス (*B. subtilis var. amyloliquefaciens*)、B. ベレゼンシス (*B. velezensis*)、カンジダ・オレオフィラ (*Candida oleophila*)、C. サイトアナ (*C. saitoana*)、クラビバクター・ミシガンエンシス (*Clavibacter michiganensis*) (バクテリオファージ)、コニオチリウム・ミニタンス (*Coniothyrium minitans*)、クリフォネクトリア・パラシティカ (*Cryphonectria parasitica*)、クリプトコックス・アルビダス (*Cryptococcus albidus*)、ジロホスホラ・アロペクリ (*Dilophospora alopecuri*)、フザリウム・オキシスポラム (*Fusarium oxysporum*)、クロノスタキス・ロゼア品種カテヌレート (*Clonostachys rosea f. catenulate*) (グリオクラディウム・カテヌラタム (*Gliocladium catenulatum*) とも命名されている)、グリオクラディウム・ロゼウム (*Gliocladium roseum*)、ライソバクター・アンチバイオチクス (*Lysobacter antibioticus*)、L. エンザイモゲネス (*L. enzymogenes*)、メツシュニコウィア・フルクチコラ (*Metschnikowia fructicola*)、ミクロドキウム・ジメルム (*Microdochium dimerum*)、ミクロスフェロプシス・オクラセア (*Microsphaeropsis ochracea*)、ムスコドル・アルブス (*Muscodor albus*)、パエニバチルス・アルベイ (*Paenibacillus alvei*)、パエニバチルス・エピフィチカス (*Paenibacillus epiphyticus*)、P. ポリミキサ (*P. polymyxa*)、パントエア・バガンズ (*Pantoea vagans*)、ペニシリウム・ビライアエ (*Penicillium bilaiae*)、フレビオプシス・ギガンテア (*Phlebiopsis gigantea*)、シュードモナス属 (*Pseudomonas sp.*)、シュードモナス・クロラフィス (*Pseudomonas chloraphis*)、シュードザイマ・フロキュロサ (*Pseudozyma flocculosa*)、ピキア・アノマラ (*Pichia anomala*)、フィチウム・オリガンドラム (*Pythium oligandrum*)、スフェロデス・ミコパラシチカ (*Sphaerodes mycoparasitica*)、ストレプトマイセス・グリセオビリディス (*Streptomyces griseoviridis*)、S. ライディカス (*S. lydicus*)、S. バイオラセウスニガー (*S. violaceus niger*)、タラロマイセス・フラバス (*Talaromyces flavus*)、トリコデルマ・アスペレロイデス (*Trichoderma asperelloides*)、T. アスペレルム (*T. asperellum*)、T. アトロビリデ (*T. atroviride*)、T. フェルティレ (*T. fertile*)、T. ガムシー (*T. gamsii*)、T. ハルマツム (*T. harmatum*)、T. ハルジアナム (*T. harzianum*)、T. ポリスポルム (*T. polysporum*)、T. ストロマチカム (*T. stromaticum*)、T. ビレンス (

10

20

30

40

50

T. virens)、*T. ビリデ* (*T. viride*)、チフラ・ファコリーザ (*Typhula phacorrhiza*)、ウロクラディウム・オウデマンシ (*Ulocladium oudemansii*)、バーティシリウム・ダリア (*Verticillium dahlia*)、ズッキーニ黄色モザイクウイルス (無毒株)；

L2) 殺真菌活性、殺細菌活性、殺ウイルス活性及び／又は植物防御活性剤活性を持った生化学的殺有害生物剤：ハルピンタンパク質、レイノウトリア・サカリネンシス (*Reynoutria sachalinensis*) 抽出物；

L3) 殺虫活性、殺ダニ活性、殺軟体動物活性及び／又は殺線虫活性を持った微生物殺有害生物剤：アクロバクテリウム・ラジオバクター (*Agrobacterium radiobacter*)、バチルス・セレウス (*Bacillus cereus*)、*B. フィルムス* (*B. firmus*)、*B. チューリングゲンシス* (*B. thuringiensis*)、*B. チューリングゲンシス* 亜種アイザワイ (*B. thuringiensis* ssp. *aizawai*)、*B. t.* 亜種イスラエレンシス (*B. t.* ssp. *israelensis*)、*B. t.* 亜種ガレリア (*B. t.* ssp. *galleriae*)、*B. t.* 亜種クルスタキ (*B. t.* ssp. *kurstaki*)、*B. t.* 亜種テネブリオニス (*B. t.* ssp. *tenebrionis*)、ボーベリア・バシアーナ (*Beauveria bassiana*)、*B. ブロングニアルティ* (*B. brongniartii*)、バルクホルデリア属 (*Burkholderia* spp.)、クロモバクテリウム・サブツガエ (*Chromobacterium subtsugae*)、シジア・ポモネラ・グラニューロウイルス (*Cydia pomonella granulovirus*) (CpGV)、クリプトフレビア・ロイコトレタ・グラニューロウイルス (*Cryptophlebia leucotreta granulovirus*) (CrleGV)、フラボバクテリウム属 (*Flavobacterium* spp.)、ヘリコベルパ・アルミゲラ (*Helicoverpa armigera*) 核多角体病ウイルス (HearNPV)、ヘリコベルパ・ゼア (*Helicoverpa zea*) 核多角体病ウイルス (HzNPV)、ヘリコベルパ・ゼア (*Helicoverpa zea*) 単一カブシド核多角体病ウイルス (HzSNPV)、ヘテロルハブジティス・バクテリオポラ (*Heterorhabdus bacteriophora*)、イサリア・フモソロセア (*Isaria fumosorosea*)、レカニシリウム・ロングスポルム (*Lecanicillium longisporum*)、*L. ムスカリウム* (*L. muscarium*)、メタルヒジウム・アニソプリエ (*Metarhizium anisopliae*)、*M. アニソプリエ* 変種 *アニソプリエ* (*M. anisopliae* var. *anisopliae*)、*M. アニソプリエ* 変種 *アクリズム* (*M. anisopliae* var. *acridum*)、ノムラエア・リレイ (*Nomuraea rileyi*)、パエシロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*)、*P. リラシヌス* (*P. lilacinus*)、パエニバチルス・ポピリアエ (*Paenibacillus popilliae*)、パスツリア属 (*Pasteuria* spp.)、*P. ニシザワエ* (*P. nishizawae*)、*P. ペネトランス* (*P. penetrans*)、*P. ラモサ* (*P. ramosa*)、*P. トルネア* (*P. thornea*)、*P. ウスガエ* (*P. usgae*)、シュードモナス・フルオレセンス (*Pseudomonas fluorescens*)、スポドプテラ・リトラリス (*Spodoptera littoralis*) 核多角体病ウイルス (SpliNPV)、ステイナーネマ・カルポカプサエ (*Steinernema carpocapsae*)、*S. フェルチアエ* (*S. feltiae*)、*S. クラウセイ* (*S. kraussei*)、ステレプトマイセス・ガルブス (*Streptomyces galbus*)、*S. ミクロフラブス* (*S. microflavus*)；

L4) 殺虫活性、殺ダニ活性、殺軟体動物活性、フェロモン活性及び／又は殺線虫活性を持った生化学的殺有害生物剤；*L-カルボン*、*シトラール*、(E, Z)-7, 9-ドデカジエン-1-イルアセテート、エチルホルメート、(E, Z)-2, 4-エチルデカジエノエート (エンドウエステル)、(Z, Z, E)-7, 11, 13-ヘキサデカトリエ

10

20

30

40

50

ナール、ヘプチルブチレート、イソプロピルミリステート、ラバヌリルセネシオエート、シスージャスモン、2-メチル 1-ブタノール、メチルオイゲノール、メチルジャスモネート、(E, Z)-2, 13-オクタデカジエン-1-オール、(E, Z)-2, 13-オクタデカジエン-1-オールアセテート、(E, Z)-3, 13-オクタデカジエン-1-オール、(R)-1-オクテン-3-オール、ペンタテルマノン、(E, Z, Z)-3, 8, 11-テトラデカトリエニルアセテート、(Z, E)-9, 12-テトラデカジエン-1-イルアセテート、(Z)-7-テトラデセン-2-オン、(Z)-9-テトラデセン-1-イルアセテート、(Z)-11-テトラデセナール、(Z)-11-テトラデセン-1-オール、アメリカアリタソウ (*Chenopodium ambrosioides*) の抽出物；ニーム油、クレイモ抽出物；

L5) 植物ストレス軽減活性、植物成長調節剤活性、植物成長促進活性及び／又は収量増大活性を持った微生物殺有害生物剤：アゾスピリウム・アマゾネンセ (*Azospirillum amazonense*)、A. ブラシレンセ (*A. brasilense*)、A. リポフェルム (*A. lipoferum*)、A. イラケンセ (*A. irakense*)、A. ハロブラエフェレンス (*A. halopraeferens*)、ブラジルヒゾビウム属 (*Bradyrhizobium* spp.)、B. エルカニ (*B. elkanii*)、B. ジャポニクム (*B. japonicum*)、B. リアオニゲンセ (*B. liaoningense*)、B. ルピニ (*B. lupini*)、デルフチア・アシドボランス (*Delftia acidovorans*)、グロムス・イントララジセス (*Glomus intraradices*)、メソルヒゾビウム属 (*Mesorhizobium* spp.)、リゾビウム・レグミノサルム bv. ファセオリ (*Rhizobium leguminosarum* bv. *phaseoli*)、R. l. bv. トリホリ (*R. l. bv. trifolii*)、R. l. bv. ビシアエ (*R. l. bv. viciae*)、R. トロピシ (*R. tropici*)、シノルヒゾビウム・メリロチ (*Sinorhizobium meliloti*)；

O) クラス O. 1～O. 29 の殺虫剤

O. 1 アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害剤：アルジカルブ、アラニカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフエンカルブ、フェノブカルブ、フォルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メトミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカルブ、プロボクスル、チオジカルブ、チオフアノクス、トリメタカルブ、XMC、キシリルカルブ、トリアザメート；アセフェート、アザメチホス、アジンホス-エチル、アジンホスメチル、カドゥサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホス-メチル、クマホス、シアノホス、デメトン-S-メチル、ジアジノン、ジクロロボス/DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルビンホス、ジスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファムフル、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、イソプロピル O- (メトキシアミノチオ-ホスホリル) サリチレート、イソオキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシデメトン-メチル、パラチオン、パラチオン-メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス-メチル、プロフェノホス、プロペタンホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルビンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、バミドチオン；

O. 2 GABA ゲートクロリドチャネル拮抗剤：エンドスルファン、クロルデン；エチプロール、フィプロニル、フルフィプロール、ピラフルプロール、ピリプロール；

O. 3 ナトリウムチャネル調節剤：アクリナトリン、アレトリン、d-シス-トランスアレトリン、d-トランスアレトリン、ピフェントリン、カップ-ピフェントリン、ピオアレトリン、ピオアレトリン S-シクロペンテニル、ピオレスメトリン、シクロプロトリ

10

20

30

40

50

ン、シフルトリン、ベーターシフルトリン、シハロトリン、ラムダーシハロトリン、ガンマーシハロトリン、シペルメトリン、アルファシペルメトリン、ベーターシペルメトリン、シーターシペルメトリン、ジーターシペルメトリン、シフェノトリン、デルタメトリン、エンペントリン、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウフルバリネート、ハルフェンプロックス、ヘプタフルトリン、イミプロトリン、メペルフルトリン、メトフルトリン、モムフルフルオロトリン、イブシロンモムフルフルオロトリン、ペルメトリン、フェノトリン、プラレトリン、プロフルトリン、ピレトリン（除虫菊）、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、カップーテフルトリン、テトラメチルフルトリン、テトラメトリン、トラロメトリン、トランスフルトリン；DDT、メトキシクロル；

10

O. 4 ニコチン性アセチルコリン受容体（nAChR）作動剤：アセタミプリド、クロチアニジン、シクロキサプリド、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリド、チアメトキサム；4，5-ジヒドロ-N-ニトロ-1-（2-オキシラニルメチル）-1H-イミダゾール-2-アミン、（2E）-1-〔（6-クロロピリジン-3-イル）メチル〕-N'-ニトロ-2-ベンチリデンヒドラジンカルボキシミダミド；1-〔（6-クロロピリジン-3-イル）メチル〕-7-メチル-8-ニトロ-5-プロポキシ-1，2，3，5，6，7-ヘキサヒドロイミダゾ〔1，2-a〕ピリジン；ニコチン；スルホキサフロル、フルピラジフロル、トリフルメゾピリム、（3R）-3-（2-クロロチアゾール-5-イル）-8-メチル-5-オキソ-6-フェニル-2，3-ジヒドロチアゾロ〔3，2-a〕ピリミジン-8-イウム-7-オレート、（3S）-3-（6-クロロ-3-ピリジル）-8-メチル-5-オキソ-6-フェニル-2，3-ジヒドロチアゾロ〔3，2-a〕ピリミジン-8-イウム-7-オレート、（3S）-8-メチル-5-オキソ-6-フェニル-3-ピリミジン-5-イル-2，3-ジヒドロチアゾロ〔3，2-a〕ピリミジン-8-イウム-7-オレート、（3R）-3-（2-クロロチアゾール-5-イル）-8-メチル-5-オキソ-6-〔3-（トリフルオロメチル）フェニル〕-2，3-ジヒドロチアゾロ〔3，2-a〕ピリミジン-8-イウム-7-オレート；（3R）-3-（2-クロロチアゾール-5-イル）-6-（3，5-ジクロロフェニル）-8-メチル-5-オキソ-2，3-ジヒドロチアゾロ〔3，2-a〕ピリミジン-8-イウム-7-オレート、（3R）-3-（2-クロロチアゾール-5-イル）-8-エチル-5-オキソ-6-フェニル-2，3-ジヒドロチアゾロ〔3，2-a〕ピリミジン-8-イウム-7-オレート；

20

30

O. 5 ニコチン性アセチルコリン受容体アロステリック活性剤：スピノサド、スピネトラム；

O. 6 クロリドチャネル活性剤：アバメクチン、エマメクチンベンゾエート、イベルメクチン、レピメクチン、ミルベメクチン；

O. 7 幼若ホルモン模倣剤：ヒドロブレン、キノブレン、メトブレン；フェノキシカルブ、ピリプロキシフェン；

O. 8 種々雑多な非特異的（マルチサイト）阻害剤：臭化メチル及び他のハロゲン化アルキル；クロルピクリン、フッ化スルフルル、ホウ砂、吐酒石；

O. 9 弦音器官TRPVチャネル調節剤：ピメトロジン、ピリフルキナゾン；

40

O. 10 ダニ成長阻害剤：クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、ジフロビダジン；エトキサゾール；

O. 11 昆虫中腸膜の微生物攪乱物質：バチルス・チューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）、バチルス・スファエリカス（*Bacillus sphaericus*）及びそれらが産生する殺虫タンパク質：バチルス・チューリングエンシス subsp. イスラエレンシス（*Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*）、バチルス・スファエリカス（*Bacillus sphaericus*）、バチルス・チューリングエンシス subsp. アイザワイ（*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*）、バチルス・チューリングエンシス subsp. クルスタキ（*Bacillus thur*

50

ingiensis subsp. kurstaki)、バチルス・チューリングエンシス subsp. テネブリオニス (Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis)、Bt 作物タンパク質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry3A/35Ab1；

O. 12 ミトコンドリアATPシンターゼの阻害剤：ジアフェンチウロン；アゾシクロチン、シヘキサチン、フェンブタチンオキシド、プロパルギット、テトラジホン；

O. 13 プロトン勾配の破壊を介した酸化的リン酸化のアンプラー：クロルフェナピル、DNOC、スルフルアミド；

O. 14 ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) チャネル遮断薬：ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラム、チオスルタプナトリウム；

O. 15 キチン生合成阻害剤タイプ0：ピストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロン、トリフルムロン；

O. 16 キチン生合成阻害剤タイプ1：ブプロフェジン；

O. 17 脱皮攪乱物質：シロマジン；

O. 18 エクダイソン受容体作動薬：メトキシフェノジド、テブフェノジド、ハロフェノジド、フフェノジド、クロマフェノジド；

O. 19 オクトパミン受容体作動薬：アミトラズ；

O. 20 ミトコンドリア複合体III電子輸送阻害剤：ヒドラメチルノン、アセキノシル、フルアクリピリム、ピフェナゼート；

O. 21 ミトコンドリア複合体I電子輸送阻害剤：フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、トルフェンピラド、ロテノン；

O. 22 電位依存性ナトリウムチャネル遮断薬：インドキサカルブ、メタフルミゾン、2-[2-(4-シアノフェニル)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン]-N-[4-(ジフルオロメトキシ)フェニル]-ヒドラジンカルボキサミド、N-(3-クロロ-2-メチルフェニル)-2-[(4-クロロフェニル)-[4[メチル(メチルスルホニル)アミノ]フェニル]メチレン]-ヒドラジンカルボキサミド；

O. 23 アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害剤：スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト、スピロピジオン；

O. 24 ミトコンドリア複合体IV電子輸送阻害剤：リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィン、リン化亜鉛、シアン化物；

O. 25 ミトコンドリア複合体II電子輸送阻害剤：シエノピラフェン、シフルメトフェン；

O. 26 ライアノジン受容体調節剤：フルベンジアミド、クロラントラニリプロール、シアントラニリプロール、シクラニリプロール、テトラニリプロール；(R)-3-クロロ-N¹-{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}-N²-(1-メチル-2-メチルスルホニルエチル)フタルアミド、(S)-3-クロロ-N¹-{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}-N²-(1-メチル-2-メチルスルホニルエチル)フタルアミド、メチル-2-[3,5-ジブromo-2-({[3-ブromo-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル}アミノ)ベンゾイル]-1,2-ジメチルヒドラジンカルボキシレート；N-[4,6-ジクロロ-2-[(ジエチル-ラムダー4-スルファニリデン)カルバモイル]-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド；N-[4-クロロ-2-[(ジエチル-ラムダー4-スルファニリデン)カルバモイル]-6-メチル-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド；N-[4-クロロ-2-[(ジ-2-ブopil-ラムダー4-スルファニリデン)カルバモイル]-6-メチル-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピ

10

20

30

40

50

ラゾール-3-カルボキサミド；N-[4,6-ジクロロ-2-[(ジ-2-プロピル-
 ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-フェニル]-2-(3-クロロ-2-
 ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド；N-[4,
 6-ジブromo-2-[(ジエチル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-フ
 エニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール
 -3-カルボキサミド；N-[2-(5-アミノ-1,3,4-チアジアゾール-2-イ
 ル)-4-クロロ-6-メチルフェニル]-3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジ
 ニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド；3-クロロ-1-(3-クロロ-2-
 ピリジニル)-N-[2,4-ジクロロ-6-[[1-(1-シアノ-1-メチルエチル)ア
 ミノ]カルボニル]フェニル]-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド；テトラクロル
 アントラニルブロール；N-[4-クロロ-2-[[1,1-ジメチルエチル)アミノ
]カルボニル]-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-(
 フルオロメトキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド；シハロジアミド；
 O.27：弦音器官調節剤 - 不明確な標的部位：フロニカミド；
 O.28.作用機序が不明若しくは不確実な殺虫性化合物：アフィドピロペン、アフォキ
 ソラネル、アザジラクチン、アミドフルメト、ベンゾキシメート、ブロフラニリド、ブロ
 モブロピレート、キノメチオナート、クリオライト、シプロフラニリド、ジクロロメゾチ
 アズ、ジコホル、フルフェネリム、フロメトキン、フルエンシルホン、フルヘキサホン、
 フルオピラム、フルララネル、メトキサジアゾン、ピペロニルブトキシド、ピフルブミド
 、ピリダリル、チオキサザフェン、11-(4-クロロ-2,6-ジメチルフェニル)-
 12-ヒドロキシ-1,4-ジオキサ-9-アザジスピロ[4.2.4.2]-テトラデ
 カ-11-エン-10-オン、3-(4'-フルオロ-2,4-ジメチルビフェニル-3
 -イル)-4-ヒドロキシ-8-オキサ-1-アザスピロ[4.5]デカ-3-エン-2
 -オン、1-[2-フルオロ-4-メチル-5-[(2,2,2-トリフルオロエチル)
 スルフィニル]フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-1,2,4-トリアゾ
 ール-5-アミン、バチルス・フィルムス(*Bacillus firmus*)I-15
 82；フルピリミン；フルアザインドリジン；4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)
 -5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2-メチル-N-
 (1-オキソチエタン-3-イル)ベンズアミド；フルキサメタミド；5-[3-[2,
 6-ジクロロ-4-(3,3-ジクロロアリルオキシ)フェノキシ]プロボキシ]-1H
 -ピラゾール；4-シアノ-N-[2-シアノ-5-[[2,6-ジブromo-4-[1,
 2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-(トリフルオロメチル)プロピル]フェニル
]カルバモイル]フェニル]-2-メチル-ベンズアミド；4-シアノ-3-[(4-シ
 アノ-2-メチル-ベンゾイル)アミノ]-N-[2,6-ジクロロ-4-[1,2,2,
 3,3,3-ヘキサフルオロ-1-(トリフルオロメチル)プロピル]フェニル]-2
 -フルオロ-ベンズアミド；N-[5-[[2-クロロ-6-シアノ-4-[1,2,2,
 3,3,3-ヘキサフルオロ-1-(トリフルオロメチル)プロピル]フェニル]カル
 バモイル]-2-シアノ-フェニル]-4-シアノ-2-メチル-ベンズアミド；N-[
 5-[[2-ブromo-6-クロロ-4-[2,2,2-トリフルオロ-1-ヒドロキシ-
 1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]カルバモイル]-2-シアノ-フェニル
]-4-シアノ-2-メチル-ベンズアミド；N-[5-[[2-ブromo-6-クロロ-
 4-[1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-(トリフルオロメチル)プロピル]
]フェニル]カルバモイル]-2-シアノ-フェニル]-4-シアノ-2-メチル-ベン
 ズアミド；4-シアノ-N-[2-シアノ-5-[[2,6-ジクロロ-4-[1,2,
 2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-(トリフルオロメチル)プロピル]フェニル]カル
 バモイル]フェニル]-2-メチル-ベンズアミド；4-シアノ-N-[2-シアノ-
 5-[[2,6-ジクロロ-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオ
 ロメチル)エチル]フェニル]カルバモイル]フェニル]-2-メチル-ベンズアミド；
 N-[5-[[2-ブromo-6-クロロ-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-
 (トリフルオロメチル)エチル]フェニル]カルバモイル]-2-シアノ-フェニル]-

4-シアノ-2-メチル-ベンズアミド；2-(1,3-ジオキサ-2-イル)-6-[2-(3-ピリジニル)-5-チアゾリル]-ピリジン；2-[6-[2-(3-ピリジニル)-5-チアゾリル]-2-ピリジニル]-ピリミジン；2-[6-[2-(3-ピリジニル)-5-チアゾリル]-2-ピリジニル]-ピリミジン；N-メチルスルホニル-6-[2-(3-ピリジニル)チアゾール-5-イル]ピリジン-2-カルボキサミド；N-メチルスルホニル-6-[2-(3-ピリジニル)チアゾール-5-イル]ピリジン-2-カルボキサミド；1-[(6-クロロ-3-ピリジニル)メチル]-1,2,3,5,6,7-ヘキサヒドロ-5-メトキシ-7-メチル-8-ニトロ-イミダゾ[1,2-a]ピリジン；1-[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル]-7-メチル-8-ニトロ-1,2,3,5,6,7-ヘキサヒドロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-5-オール；1-イソプロピル-N,5-ジメチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド；1-(1,2-ジメチルプロピル)-N-エチル-5-メチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド；N,5-ジメチル-N-ピリダジン-4-イル-1-(2,2,2-トリフルオロ-1-メチル-エチル)ピラゾール-4-カルボキサミド；1-[1-(1-シアノシクロプロピル)エチル]-N-エチル-5-メチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド；N-エチル-1-(2-フルオロ-1-メチル-プロピル)-5-メチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド；1-(1,2-ジメチルプロピル)-N,5-ジメチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド；1-[1-(1-シアノシクロプロピル)エチル]-N,5-ジメチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド；N-メチル-1-(2-フルオロ-1-メチル-プロピル)-5-メチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド；1-(4,4-ジフルオロシクロヘキシル)-N-エチル-5-メチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド；1-(4,4-ジフルオロシクロヘキシル)-N,5-ジメチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド、N-(1-メチルエチル)-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド；Nシクロプロピル-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド；Nシクロヘキシル-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド；2-(3-ピリジニル)-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド；2-(3-ピリジニル)-N-[(テトラヒドロ-2-フラニル)メチル]-2H-インダゾール-5-カルボキサミド；メチル 2-[2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-5-イル]カルボニル]ヒドラジンカルボキシレート；N-[(2,2-ジフルオロシクロプロピル)メチル]-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-5-カルボキサミド；N-(2,2-ジフルオロプロピル)-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-5-カルボキサミド；2-(3-ピリジニル)-N-(2-ピリミジニルメチル)-2H-インダゾール-5-カルボキサミド；N-[(5-メチル-2-ピラジニル)メチル]-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-5-カルボキサミド、チクロピラゾフロル；サロラネル、ロチラネル、N-[4-クロロ-3-[(フェニルメチル)アミノ]カルボニル]フェニル]-1-メチル-3-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)-4-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド；2-(3-エチルスルホニル-2-ピリジニル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-b]ピリジン、2-[3-エチルスルホニル-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジニル]-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-b]ピリジン、イソシクロセラム、N-[4-クロロ-3-(シクロプロピルカルバモイル)フェニル]-2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)-4-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド、N-[4-クロロ-3-[(1-シアノシクロプロピル)カルバモイル]フェニル]-2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)-4-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド；アシノナピル；ベンズピリモキサン；チゴラネル；クロロ-N-(1-シアノシクロ

10

20

30

40

50

ロピル) - 5 - [1 - [2 - メチル - 5 - (1, 1, 2, 2, 2 - ペンタフルオロエチル) - 4 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 3 - イル] ピラゾール - 4 - イル] ベンズアミド、オキサゾスルフィル、[(2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 3, 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - 4 - プロボキシ - テトラヒドロピラン - 2 - イル] - N - [4 - [1 - [4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル] フェニル] カルバメート、[(2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 3, 4, 5 - トリメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル] N - [4 - [1 - [4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル] フェニル] カルバメート、[(2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 3, 5 - ジメトキシ - 6 - メチル - 4 - プロボキシ - テトラヒドロピラン - 2 - イル] - N - [4 - [1 - [4 - (1, 1, 2, 2, 2 - ペンタフルオロエトキシ) フェニル] - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル] フェニル] カルバメート、[(2S, 3R, 4R, 5S, 6S) - 3, 4, 5 - トリメトキシ - 6 - メチル - テトラヒドロピラン - 2 - イル] - N - [4 - [1 - [4 - (1, 1, 2, 2, 2 - ペンタフルオロエトキシ) フェニル] - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル] フェニル] カルバメート、(2Z) - 3 - (2 - イソプロピルフェニル) - 2 - [(E) - [4 - [1 - [4 - (1, 1, 2, 2, 2 - ペンタフルオロエトキシ) フェニル] - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル] フェニル] メチレンヒドラゾノ] チアゾリジン - 4 - オン; 2 - (6 - クロロ - 3 - エチルスルホニル - イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン、2 - (6 - ブロモ - 3 - エチルスルホニル - イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン、2 - (3 - エチルスルホニル - 6 - ヨード - イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン、2 - [3 - エチルスルホニル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン、2 - (7 - クロロ - 3 - エチルスルホニル - イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン、2 - (3 - エチルスルホニル - 7 - ヨード - イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン、3 - エチルスルホニル - 6 - ヨード - 2 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル] イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 8 - カルボニトリル、2 - [3 - エチルスルホニル - 8 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン、2 - [3 - エチルスルホニル - 7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン、2 - [3 - エチルスルホニル - 7 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン、2 - (6 - ブロモ - 3 - エチルスルホニル - イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4, 3 - c] ピリジン。

[0204]

成分2として言及される活性物質、それらの調製及びそれらの、例えば有害真菌に対する活性は、公知であり(<http://www.alanwood.net/pesticides/>を参照されたい); これらの物質は市販されている。IUPAC命名法で記載されている化合物、それらの調製及びそれらの殺有害生物活性も公知である(Can. J. Plant Sci. 48(6), 587-94, 1968; 欧州特許出願公開第A141317号明細書; 欧州特許出願公開第A152031号明細書; 欧州特許出願公開第A226917号明細書; 欧州特許出願公開第A243970号明細書; 欧州特許出願公開第A256503号明細書; 欧州特許出願公開第A428941号明細書; 欧州特許出願公開第A532022号明細書; 欧州特許出願公開第A1028

125号明細書；欧州特許出願公開第A1 035 122号明細書；欧州特許出願公開第A1 201 648号明細書；欧州特許出願公開第A1 122 244号明細書；特開2002-316902号公報；独国特許第19650197号明細書；独国特許第10021412号明細書；独国特許第102005009458号明細書；米国特許第3, 296, 272号明細書；米国特許第3, 325, 503号明細書；国際公開第98/46608号パンフレット；国際公開第99/14187号パンフレット；国際公開第99/24413号パンフレット；国際公開第99/27783号パンフレット；国際公開第00/29404号パンフレット；国際公開第00/46148号パンフレット；国際公開第00/65913号パンフレット；国際公開第01/54501号パンフレット；国際公開第01/56358号パンフレット；国際公開第02/22583号パンフレット；国際公開第02/40431号パンフレット；国際公開第03/10149号パンフレット；国際公開第03/11853号パンフレット；国際公開第03/14103号パンフレット；国際公開第03/16286号パンフレット；国際公開第03/53145号パンフレット；国際公開第03/61388号パンフレット；国際公開第03/66609号パンフレット；国際公開第03/74491号パンフレット；国際公開第04/49804号パンフレット；国際公開第04/83193号パンフレット；国際公開第05/120234号パンフレット；国際公開第05/123689号パンフレット；国際公開第05/123690号パンフレット；国際公開第05/63721号パンフレット；国際公開第05/87772号パンフレット；国際公開第05/87773号パンフレット；国際公開第06/15866号パンフレット；国際公開第06/87325号パンフレット；国際公開第06/87343号パンフレット；国際公開第07/82098号パンフレット；国際公開第07/90624号パンフレット；国際公開第10/139271号パンフレット；国際公開第11/028657号パンフレット；国際公開第12/168188号パンフレット；国際公開第07/006670号パンフレット；国際公開第11/77514号パンフレット；国際公開第13/047749号パンフレット；国際公開第10/069882号パンフレット；国際公開第13/047441号パンフレット；国際公開第03/16303号パンフレット；国際公開第09/90181号パンフレット；国際公開第13/007767号パンフレット；国際公開第13/010862号パンフレット；国際公開第13/127704号パンフレット；国際公開第13/024009号パンフレット；国際公開第13/24010号パンフレット；国際公開第13/047441号パンフレット；国際公開第13/162072号パンフレット；国際公開第13/092224号パンフレット；国際公開第11/135833号パンフレット；中国特許第1907024号明細書；中国特許第1456054号明細書；中国特許第103387541号明細書；中国特許第1309897号明細書；国際公開第12/84812号パンフレット；中国特許第1907024号明細書；国際公開第09094442号パンフレット；国際公開第14/60177号パンフレット；国際公開第13/116251号パンフレット；国際公開第08/013622号パンフレット；国際公開第15/65922号パンフレット；国際公開第94/01546号パンフレット；欧州特許第2865265号明細書；国際公開第07/129454号パンフレット；国際公開第12/165511号パンフレット；国際公開第11/081174号パンフレット；国際公開第13/47441号パンフレット；国際公開第16/156241号パンフレット；国際公開第16/162265号パンフレットを参照されたい）。いくつかの化合物は、第1が2桁～7桁以下からなり、第2が2桁からなり、第3が1桁からなる3部にハイフンで区切られているそれらのCAS登録番号によって識別される。

【0205】

本発明によれば、（ニーム油などの油を除いて）バイオ殺有害生物剤の固体物質（乾燥物質）は、（例えば、微生物殺有害生物剤の液体製剤の場合に、抽出又は懸濁媒体の乾燥又は蒸発後に得られる）活性成分と見なされる。Quillay抽出物などの生物学的抽出物について使用される重量比及び百分率は、それぞれの抽出物の乾燥含有量（固体物質）の総重量を基準とする。

10

20

30

40

50

【0206】

休眠形態を含む生存微生物細胞の形態の少なくとも1種の微生物殺有害生物剤を含む組成物の総重量比は、 1×10^{10} CFUがそれぞれの活性成分の総重量1グラムに等しいという式によってそれぞれの活性成分の総重量を計算するために、それぞれの微生物のCFUの量を用いて決定することができる。コロニー形成単位は、生存可能な微生物細胞の尺度である。更に、CFUはまた、ステオネルネマ・フェルチアエ (*Steinernema feltiae*) などの、線虫生物殺有害生物剤の場合、(幼若の) 個々の線虫の数として理解され得る。

【0207】

二元混合物において、成分1)と成分2)との重量比は、一般に、使用される成分の特性に依存し、通常、それは、1:10, 000~10, 000:1、多くの場合に1:100~100:1、普通は1:50~50:1、好ましくは1:20~20:1、より好ましくは1:10~10:1、更により好ましくは1:4~4:1、特に1:2~2:1の範囲にある。更なる実施形態によれば、成分1)と成分2)との重量比は、通常、1000:1~1:1、多くの場合に100:1~1:1、普通は50:1~1:1、好ましくは20:1~1:1、より好ましくは10:1~1:1、更により好ましくは4:1~1:1、特に2:1~1:1の範囲にある。更なる実施形態によれば、成分1)と成分2)との重量比は、通常、20, 000:1~1:10、多くの場合に10, 000:1~1:1、普通は5, 000:1~5:1、好ましくは5, 000:1~10:1、より好ましくは2, 000:1~30:1、更により好ましくは2, 000:1~100:1、特に1, 000:1~100:1の範囲にある。更なる実施形態によれば、成分1)と成分2)との重量比は、通常、1:1~1:1000、多くの場合に1:1~1:100、普通は1:1~1:50、好ましくは1:1~1:20、より好ましくは1:1~1:10、更により好ましくは1:1~1:4、特に1:1~1:2の範囲にある。更なる実施形態によれば、成分1)と成分2)との重量比は、通常、10:1~1:20, 000、多くの場合に1:1~1:10, 000、普通は1:5~1:5, 000、好ましくは1:10~1:5, 000、より好ましくは1:30~1:2, 000、更により好ましくは1:100~1:2, 000、特に1:100~1:1, 000の範囲にある。

【0208】

三元混合物、すなわち成分1)及び成分2)及び化合物III (成分3)を含む組成物において、成分1)と成分2)との重量比は、使用される活性物質の特性に依存し、通常、それは、1:100~100:1、普通は1:50~50:1、好ましくは1:20~20:1、より好ましくは1:10~10:1、特に1:4~4:1の範囲にあり、成分1)と成分3)との重量比は、通常、1:100~100:1、普通は1:50~50:1、好ましくは1:20~20:1、より好ましくは1:10~10:1、特に1:4~4:1の範囲にある。任意の更なる活性成分は、必要に応じて、成分1)に対して20:1~1:20の割合で添加される。これらの比率は、種子処理によって適用される混合物にとっても好適である。

【0209】

微生物殺有害生物剤を含む混合物が作物保護に使用される場合、適用率は、 1×10^6 ~ 5×10^{16} (以上) CFU/ha、好ましくは 1×10^8 ~ 1×10^{13} CFU/ha、更により好ましくは 1×10^9 ~ 5×10^{15} CFU/ha、特に 1×10^{12} ~ 5×10^{14} CFU/haの範囲である。微生物殺有害生物剤としての線虫(例えば、ステイネルネマ・フェルチアエ (*Steinernema feltiae*)) の場合、適用率は、普通は1ヘクタール当たり 1×10^5 ~ 1×10^{12} (以上)、好ましくは 1×10^8 ~ 1×10^{11} 、より好ましくは 5×10^8 ~ 1×10^{10} 個体(例えば、卵、幼若又は任意の他の生段階の形態での、好ましくは未成熟の幼若段階での)の範囲である。

【0210】

微生物殺有害生物剤を含む混合物が種子処理に使用される場合、適用率は、一般に、 1×10^6 ~ 1×10^{12} (以上) CFU/種子、好ましくは 1×10^6 ~ 1×10^9 CF

10

20

30

40

50

U／種子の範囲である。更に、種子処理に対する適用率は、一般に、種子の100kg当たり $1 \times 10^7 \sim 1 \times 10^{14}$ （以上）CFU、好ましくは種子の100kg当たり $1 \times 10^9 \sim 1 \times 10^{12}$ CFUの範囲である。

【0211】

成分2）として、A）群のQ₀部位における複合体IIIの阻害剤から選択される、より好ましくは化合物（A.1.1）、（A.1.4）、（A.1.8）、（A.1.9）、（A.1.10）、（A.1.12）、（A.1.13）、（A.1.14）、（A.1.17）、（A.1.21）、（A.1.25）、（A.1.34）及び（A.1.35）から選択される；特に（A.1.1）、（A.1.4）、（A.1.8）、（A.1.9）、（A.1.13）、（A.1.14）、（A.1.17）、（A.1.25）、（A.1.34）及び（A.1.35）から選択される少なくとも1種の活性物質を含む混合物が好ましい。

10

【0212】

成分2）として、A）群のQ_i部位における複合体IIIの阻害剤から選択される、より好ましくは化合物（A.2.1）、（A.2.3）、（A.2.4）及び（A.2.6）から選択される；特に（A.2.3）、（A.2.4）及び（A.2.6）から選択される少なくとも1種の活性物質を含む混合物が好ましい。

【0213】

成分2）として、A）群の複合体IIの阻害剤から選択される、より好ましくは化合物（A.3.2）、（A.3.3）、（A.3.4）、（A.3.7）、（A.3.9）、（A.3.11）、（A.3.12）、（A.3.15）、（A.3.16）、（A.3.17）、（A.3.18）、（A.3.19）、（A.3.20）、（A.3.21）、（A.3.22）、（A.3.23）、（A.3.24）、（A.3.28）、（A.3.31）、（A.3.32）、（A.3.33）、（A.3.34）、（A.3.35）、（A.3.36）、（A.3.37）、（A.3.38）及び（A.3.39）から選択される；特に（A.3.2）、（A.3.3）、（A.3.4）、（A.3.7）、（A.3.9）、（A.3.12）、（A.3.15）、（A.3.17）、（A.3.19）、（A.3.22）、（A.3.23）、（A.3.24）、（A.3.31）、（A.3.32）、（A.3.33）、（A.3.34）、（A.3.35）、（A.3.36）、（A.3.37）、（A.3.38）及び（A.3.39）から選択される少なくとも1種の活性物質を含む混合物が好ましい。

20

30

【0214】

成分2）として、A）群の他の呼吸阻害剤から選択される、より好ましくは化合物（A.4.5）及び（A.4.11）から選択される少なくとも1種の活性物質；特に（A.4.11）を含む混合物も好ましい。

【0215】

成分2）として、B）群のC14脱メチラーゼ阻害剤から選択される、より好ましくは化合物（B.1.4）、（B.1.5）、（B.1.8）、（B.1.10）、（B.1.11）、（B.1.12）、（B.1.13）、（B.1.17）、（B.1.18）、（B.1.21）、（B.1.22）、（B.1.23）、（B.1.25）、（B.1.26）、（B.1.29）、（B.1.34）、（B.1.37）、（B.1.38）、（B.1.43）、（B.1.46）、（B.1.53）、（B.1.54）及び（B.1.55）から選択される；特に（B.1.5）、（B.1.8）、（B.1.10）、（B.1.17）、（B.1.22）、（B.1.23）、（B.1.25）、（B.1.33）、（B.1.34）、（B.1.37）、（B.1.38）、（B.1.43）及び（B.1.46）から選択される少なくとも1種の活性物質を含む混合物も好ましい。成分2）として、B）群のデルタ14-レダクターゼ阻害剤から選択される、より好ましくは化合物（B.2.4）、（B.2.5）、（B.2.6）及び（B.2.8）から選択される少なくとも1種の活性物質；特に（B.2.4）を含む混合物も好ましい。

40

50

【0216】

成分2)として、C)群のフェニルアミド及びアシルアミノ酸殺真菌剤から選択される、より好ましくは化合物(C. 1. 1)、(C. 1. 2)、(C. 1. 4)及び(C. 1. 5)から選択される；特に(C. 1. 1)及び(C. 1. 4)から選択される少なくとも1種の活性物質を含む混合物も好ましい。

【0217】

成分2)として、C)群の他の核酸合成阻害剤から選択される、より好ましくは化合物(C. 2. 6)、(C. 2. 7)及び(C. 2. 8)から選択される少なくとも1種の活性物質を含む混合物も好ましい。

【0218】

成分2)として、D)群から選択される、より好ましくは化合物(D. 1. 1)、(D. 1. 2)、(D. 1. 5)、(D. 2. 4)及び(D. 2. 6)から選択される；特に(D. 1. 2)、(D. 1. 5)及び(D. 2. 6)から選択される少なくとも1種の活性物質を含む混合物も好ましい。

10

【0219】

成分2)として、E)群から選択される、より好ましくは化合物(E. 1. 1)、(E. 1. 3)、(E. 2. 2)及び(E. 2. 3)から選択される少なくとも1種の活性物質；特に(E. 1. 3)を含む混合物も好ましい。

【0220】

成分2)として、F)群から選択される、より好ましくは化合物(F. 1. 2)、(F. 1. 4)及び(F. 1. 5)から選択される少なくとも1種の活性物質を含む混合物も好ましい。

20

【0221】

成分2)として、G)群から選択される、より好ましくは化合物(G. 3. 1)、(G. 3. 3)、(G. 3. 6)、(G. 5. 1)、(G. 5. 3)、(G. 5. 4)、(G. 5. 5)、(G. 5. 6)、(G. 5. 7)、(G. 5. 8)、(G. 5. 9)、(G. 5. 10)及び(G. 5. 11)から選択される；特に(G. 3. 1)、(G. 5. 1)及び(G. 5. 3)から選択される少なくとも1種の活性物質を含む混合物も好ましい。

【0222】

成分2)として、H)群から選択される、より好ましくは化合物(H. 2. 2)、(H. 2. 3)、(H. 2. 5)、(H. 2. 7)、(H. 2. 8)、(H. 3. 2)、(H. 3. 4)、(H. 3. 5)、(H. 4. 9)及び(H. 4. 10)から選択される；特に(H. 2. 2)、(H. 2. 5)、(H. 3. 2)、(H. 4. 9)及び(H. 4. 10)から選択される少なくとも1種の活性物質を含む混合物も好ましい。

30

【0223】

成分2)として、I)群から選択される、より好ましくは化合物(I. 2. 2)及び(I. 2. 5)から選択される少なくとも1種の活性物質を含む混合物も好ましい。

【0224】

成分2)として、J)群から選択される、より好ましくは化合物(J. 1. 2)、(J. 1. 5)、(J. 1. 8)、(J. 1. 11)及び(J. 1. 12)から選択される少なくとも1種の活性物質；特に(J. 1. 5)を含む混合物も好ましい。

40

【0225】

成分2)として、K)群から選択される、より好ましくは化合物(K. 1. 41)、(K. 1. 42)、(K. 1. 44)、(K. 1. 47)、(K. 1. 57)、(K. 1. 58)及び(K. 1. 59)から選択される；特に(K. 1. 41)、(K. 1. 44)、(K. 1. 47)、(K. 1. 57)、(K. 1. 58)及び(K. 1. 59)から選択される少なくとも1種の活性物質を含む混合物も好ましい。

【0226】

L1)群及び／又はL2)群からのバイオ殺有害生物剤は、殺虫活性、殺ダニ活性、殺

50

軟体動物活性、フェロモン活性、殺線虫活性、植物ストレス軽減活性、植物成長調節物質活性、植物成長促進活性及び／又は収量増加活性も有し得る。L3)群及び／又はL4)群からのバイオ殺有害生物剤は、殺真菌活性、殺菌活性、殺ウイルス活性、植物防御活性物活性、植物ストレス軽減活性、植物成長調節剤活性、植物成長促進活性及び／又は収量増加活性も有し得る。L5)群からのバイオ殺有害生物剤は、殺真菌活性、殺菌活性、殺ウイルス活性、植物防御活性物活性、殺虫活性、殺ダニ活性、殺軟体動物活性、フェロモン活性及び／又は殺線虫活性も有し得る。

【0227】

微生物殺有害生物剤、特にL1)群、L3)群及びL5)群からのものは、本明細書で定義されるようなそれぞれの微生物の単離された、純粋な培養物だけでなく、その無細胞抽出物、全ブロス培養物中のその懸濁液及び代謝産物含有培養培地又は微生物の全ブロス培養物から得られる精製代謝産物も包含する。

【0228】

これらのバイオ殺有害生物剤の多くは、本明細書中で言及される寄託番号で寄託されており（ATCC又はDSMなどの接頭語は、それぞれのカルチャーコレクションの頭字語を言い、詳細については、例えばここで：http://www.wfcc.info/ccinfo/collection/by_acronym/を参照されたい）、文献中で言及されており、登録されており及び／又は市販されている：Konstanz, Germanyで1989年に単離されたオーレオバシディウム・プルランス（*Aureobasidium pullulans*）DSM 14940及びDSM 14941の混合物（例えば、bio-ferm GmbH, AustriaからのBlossomp Protect（登録商標）中の分芽芽胞）、少なくとも1980年より前にSouth Brazilの小麦地帯（Passo Fundo）で元来単離されたアゾスピリルム・ブラジレンス（*Azospirillum brasilense*）Sp245（BR11005；例えば、BASF Agricultural Specialties Ltd., BrazilからのGELFIX（登録商標）Gramineas）、A. ブラジレンス（*A. brasilense*）株Ab-V5及びAb-V6（例えば、Novozymes BioAg Produtos papra Agricultura Ltda., Quattro Barras, BrazilからのAzoMax又はSimbiose-Agro, BrazilからのSimbiose-Maiz（登録商標）中のもの；Plant Soil 331, 413-425, 2010）、バチルス・アミロリクエファシエンス（*Bacillus amyloliquefaciens*）株AP-188（NRRL B-50615及びB-50331；米国特許第8,445,255号明細書）；B. アミロリクエファシエンス属種プランタルム（*B. amyloliquefaciens* spp. *plantarum*）株（以前はB. サブチリス（*B. subtilis*）と言われることもあった、現在はB. メチロトロフィカス（*B. methylophilus*）及びB. ベレゼンシス（*B. velezensis*）と一緒にB. ベレゼンシス（*B. velezensis*）として分類される）（Int. J. Syst. Evol. Microbiol. 66, 1212-1217, 2016）：日本菊川市の空気から単離されたB. a. 亜種プランタルム（*B. a. ssp. plantarum*）又はB. ベレゼンシス（*B. velezensis*）D747（米国特許出願公開第20130236522A1号明細書；FERM BP-8234；例えば、Certis LLC, USAからのDouble Nickel（商標）55 WD G）、Brandenburg, Germanyの土壌から単離されたB. a. 亜種プランタルム（*B. a. ssp. plantarum*）又はB. ベレゼンシス（*B. velezensis*）FZB24（SB3615とも呼ばれる；DSM96-2；J. Plant Dis. Prot. 105, 181-197, 1998；例えば、Novozyme Biologicals, Inc., USAからのTaegro（登録商標））、Brandenburg, Germanyの土壌から単離されたB. a. 亜種プランタルム（*B. a. ssp. plantarum*）又はB. ベレゼンシス（*B. velezensis*）

10

20

30

40

50

) FZB 42 (DSM 23117; J. Plant Dis. Prot. 105, 181-197, 1998; 例えば、AbiTEP GmbH, GermanyからのRhizoVital (登録商標) 42)、少なくとも1988年より前にSutton Bonington, Nottinghamshire, U. K. でソラマメから単離されたB. a. 亜種プラントルム (B. a. ssp. plantarum) 又はB. ベレゼンシス (B. velezensis) MBI 600 (1430とも呼ばれる; NRRL B-50595; 米国特許出願公開第2012/0149571A1号明細書; 例えば、BASF Corp., USAからのIntegral (登録商標)、California, U. S. A. で1995年にモモ果樹園から単離されたB. a. 亜種プラントルム (B. a. ssp. plantarum) 又はB. ベレゼンシス (B. velezensis) QST-713 (NRRL B-21661; 例えば、Bayer Crop Science LP, USAからのSerenade (登録商標) MAX)、South Dakota, U. S. A. で1992年に単離されたB. a. 亜種プラントルム (B. a. ssp. plantarum) 又はB. ベレゼンシス (B. velezensis) TJ1000 (1BEとも呼ばれる; ATCC BAA-390; カナダ国特許出願公開第2471555A1号明細書; 例えば、TJ Technologies, Watertown, SD, USAからのQuickRoots (商標)); B. ファームス (B. firmus) CNCM I-1582 (Israelの中央平原地帯の土壌から単離された親株EIP-N1 (CNCM I-1556) の変異株) (国際公開第2009/126473号パンフレット、米国特許第6,406,690号明細書; 例えばBayer Crop Science LP, USAからのVotivo (登録商標)、Mexicoでリンゴ樹木の根圏から単離されたB. プミルス (B. pumilus) GHA 180 (IDAC 260707-01; 例えば、Premier Horticulture, Quebec, CanadaからのPRO-MIX (登録商標) BX)、エルウィニア・トラケイフィラ (Erwinia tracheiphila) がはびこったキュウリから少なくとも1993年より前に単離されたB. プミルス (B. pumilus) INR-7 (BU-F22及びBU-F33と別途言われる) (NRRL B-50185、NRRL B-50153; 米国特許第8,445,255号明細書)、少なくとも2008年以前にSouth Africaの牧草の根圏から単離されたB. プミルス (B. pumilus) KFP9F (NRRL B-50754; 国際公開第2014/029697号パンフレット; 例えば、BASF Agricultural Specialities (Pty) Ltd., South AfricaからのBAC-UP又はFUSION-P)、B. プミルス (B. pumilus) QST 2808は、1998年にPohnpei, Federated States of Micronesiaで収集された土壌から単離された (NRRL B-30087; 例えば、Bayer Crop Science LP, USAからのSonata (登録商標) 又はBallad (登録商標) Plus)、B. シンプレックス (B. simplex) ABU 288 (NRRL B-50304; 米国特許第8,445,255号明細書)、North Americaでレッドビートの根から単離されたB. サブチリス (B. subtilis) FB17 (UD 1022又はUD 10-22とも呼ばれる) (ATCC PTA-11857; System. Appl. Microbiol. 27, 372-379, 2004; 米国特許出願公開第2010/0260735号明細書; 国際公開第2011/109395号パンフレット); 1987年に、Ephraim, Wisconsin, U. S. A. の芝土から採取された土壌から単離されたB. チューリングゲンシス亜種アイザワイ (B. thuringiensis ssp. aizawai) ABTS-1857 (ABG-6346とも呼ばれる; ATCC SD-1372; 例えば、BioFa AG, Muensingen, GermanyからのXenTari (登録商標))、Brownsville, Texas, U. S. A. で罹患したワタキバガの黒色幼虫から1967年に単離されたHD-1と同一のB. t. 亜種クルスタキ (B. t. ssp. kurstaki) ABTS-351 (ATCC SD-1275; 例えば、Valent

10

20

30

40

50

BioSciences, IL, USAからのDipel (登録商標) DF)、E. サッカリナ (*E. saccharina*) の幼虫の死骸から単離されたB. t. 亜種クルスタキ (*B. t. ssp. kurstaki*) SB4 (NRRL B-50753; 例えば、BASF Agricultural Specialities (Pty) Ltd., South AfricaからのBeta Pro (登録商標))、B. t. 亜種テネブリオニス (*B. t. ssp. tenebrionis*) NB-176-1 (甲虫チャイロコメノゴミムシ (*Tenebrio molitor*) の死んだ蛹から1982年に単離された野生型株であるNB-125株の突然変異株) (DSM 5480; 欧州特許第585215B1号明細書; 例えば、Valent BioSciences, SwitzerlandからのNovodor (登録商標))、ボーベリア・バシアーナ (*Beauveria bassiana*) GHA (ATCC 74250; 例えば、Laverlam Int. Corp., USAからのBotaniGard (登録商標) 22WGP)、B. バシアーナ (*B. bassiana*) JW-1 (ATCC 74040; 例えば、CBC (Europe) S. r. l., ItalyからのNaturalis (登録商標))、カメノコハムシであるコンキロクテナ・プンクタータ (*Conchyloctenia punctata*) の幼虫から単離されたB. バシアーナ (*B. bassiana*) PPRI 5339 (NRRL 50757; 例えば、BASF Agricultural Specialities (Pty) Ltd., South AfricaからのBroadBand (登録商標))、Rio de Janeiro, Brazilで単離されたブラジルヒゾビウム・エルカニ (*Bradyrhizobium elkanii*) 株SEMIA 5019 (29Wとも呼ばれる) 及び北米単離株が以前接種された地域から、Rio Grande do Sul州で1967年に単離された、及び1968年から市販の接種物中で使用されているSEMIA 587 (Appl. Environ. Microbiol. 73 (8), 2635, 2007; 例えば、BASF Agricultural Specialties Ltd., BrazilからのGELFIX 5)、U. S. A. でWisconsinの圃場から単離されたB. ジャポニクム (*B. japonicum*) 532c (Nitragin 61A152; Can. J. Plant. Sci. 70, 661-666, 1990; 例えば、BASF Agricultural Specialties Ltd., CanadaからのRhizoflo (登録商標)、Histick (登録商標)、Hicoat (登録商標) Super中のもの)、USDA 138株のB. ジャポニクム (*B. japonicum*) E-109変異株 (INTA E109、SEMIA 5085; Eur. J. Soil Biol. 45, 28-35, 2009; Biol. Fertil. Soils 47, 81-89, 2011); SEMIAに寄託され、Appl. Environ. Microbiol. 73 (8), 2635, 2007から公知のB. ジャポニクム (*B. japonicum*) 株: Embrapa-CerradosによりBrazilのCerrados地方の土壌から単離され、1992年から市販の接種物中で使用されているSEMIA 5079 (CPAC 15; 例えば、BASF Agricultural Specialties Ltd., BrazilからのGELFIX 5又はADHERE 60)、BrazilでEmbrapa-Cerradosにより実験室条件下で得られ、1992年から市販の接種物中で使用されており、元来U. S. A. で単離されたSEMIA 586 (CB1809) の天然変異株である、B. ジャポニクム (*B. japonicum*) SEMIA 5080 (CPAC 7; 例えば、BASF Agricultural Specialties Ltd., BrazilからのGELFIX 5又はADHERE 60); 2008年に日本日光の土壌から単離されたバルクホルデリア属種 (*Burkholderia* sp.) A396 (NRRL B-50319; 国際公開第2013/032693号パンフレット; Marrone Bio Innovations, Inc., USA)、ナタネから単離されたコニオチリウム・ミニタンス (*Coniothyrium minitans*) CON/M/91-08 (国際公開第1996/021358号パンフレット; DSM 9660; 例えば、B

10

20

30

40

50

ayer Crop Science AG, GermanyからのContans (登録商標) WG、Intercept (登録商標) WG)、ハーピン (アルファベータ) タンパク質 (Science 257, 85-88, 1992; 例えば、Plant Health Care plc, U. K. からのMessenger (商標) 又はHARP-N Tek)、オオタバコガ (Helicoverpa armigera) 核多角体病ウイルス (HearNPV) (J. Invertebrate Pathol. 107, 112-126, 2011; 例えば、Adermatt Biocontrol, SwitzerlandからのHelicovex (登録商標); Koppert, BrazilからのDiplomata (登録商標); AgBiTech Pty Ltd., Queensland, AustraliaからのVivus (登録商標) Max)、アメリカタバコガ (Helicoverpa zea) 単一カブシド核多角体病ウイルス (H zSNPV) (例えば、Certis LLC, USAからのGemstar (登録商標))、アメリカタバコガ (Helicoverpa zea) 核多角体病ウイルスABA-NPV-U (例えば、AgBiTech Pty Ltd., Queensland, AustraliaからのHeligen (登録商標))、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ (Heterorhabdus bacteriophora) (例えば、BASF Agricultural Specialities Limited, UKからのNemasys (登録商標) G)、Apopka, Florida, U. S. A. でサンシチソウ (gynura) に係るコナカイガラムシから単離されたイサリア・フモソロセア (Isaria fumosorosea) Apopka-97 (ATCC 20874; Biocontrol Science Technol. 22 (7), 747-761, 2012; 例えば、Certis LLC, USAからのPFR-97 (商標) 又はPreFeRal (登録商標))、Austriaでコドリンガから単離されたメタリジウム・アニソプリエ変種アニソプリエ (Metarhizium anisopliae var. anisopliae) F52 (275又はV275とも呼ばれる) (DSM 3884、ATCC 90448; 例えば、Met52 (登録商標) Novozymes Biologicals BioAg Group, Canada)、Israelの中央部でのブドウから単離されたメツシュニコウィア・フルクチコラ (Metschnikowia fructicola) 277 (米国特許第6, 994, 849号明細書; NRRL Y-30752; 例えば、Agrogreen, Israelからの以前のShemer (登録商標))、Philippinesで感染した線虫の卵から単離されたペシロマイセス・イラシヌス (Paecilomyces ilacinus) 251 (AGAL 89/030550; 国際公開第1991/02051号パンフレット; Crop Protection 27, 352-361, 2008; 例えば、Bayer Crop Science AG, GermanyからのBioAct (登録商標) 及びCertis, USAからのMeloCon (登録商標))、少なくとも2008年以前にSouth Africaの牧草の根圏から単離されたパエニバシルス・アルベイ (Paenibacillus alvei) NAS6G6 (国際公開第2014/029697号パンフレット; NRRL B-50755; 例えば、BASF Agricultural Specialities (Pty) Ltd., South AfricaからのBAC-UP)、Germanyを含むヨーロッパの様々な場所からの土壌サンプルから単離されたパエニバシルス (Paenibacillus) 株: P. エピフィチカス (P. epiphyticus) Lu17015 (国際公開第2016/020371号パンフレット; DSM 26971)、P. ポリミキサ亜種プランタルム (P. polymyxa ssp. plantarum) Lu16774 (国際公開第2016/020371号パンフレット; DSM 26969)、P. p. 亜種プランタルム (P. p. ssp. plantarum) 株Lu17007 (国際公開第2016/020371号パンフレット; DSM 26970); Illinois, U. S. Aで2000年代半ばにダイズ圃場から単離されたパストリア・ニシザワエ (Pasteuria nishizawae) Pn1 (ATCC SD-5833; Federal Re

10

20

30

40

50

gister 76 (22), 5808, February 2, 2011; 例えば、Syngenta Crop Protection, LLC, USAからのClariva (商標) PN)、Alberta, Canadaでの土壌から元来単離されたペニシリウム・ビライアエ (*Penicillium bilaiae*) (P. ビライ (P. *bilaiae*) とも呼ばれる) 株 ATCC 18309 (= ATCC 74319)、ATCC 20851 及び／又は ATCC 22348 (= ATCC 74318) (Fertilizer Res. 39, 97-103, 1994; Can. J. Plant Sci. 78 (1), 91-102, 1998; 米国特許第5,026,417号明細書、国際公開第1995/017806号パンフレット; 例えば、Novozymes Biologicals BioAg Group, CanadaからのJump Start (登録商標)、Provide (登録商標)、オオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*) 抽出物 (欧州特許第0307510B1号明細書; 例えば、Marrone BioInnovations, Davis, CA, USAからのRegalia (登録商標) SC又はBioFa AG, GermanyからのMilsana (登録商標)、ステイネルネマ・カルボカプサエ (*Steinernema carpocapsae*) (例えば、BASF Agricultural Specialities Limited, UKからのMillenium (登録商標)、S. フェルチアエ (*S. feltiae*) (例えば、BioWorks, Inc., USAからのNemashield (登録商標); BASF Agricultural Specialities Limited, UKからのNemasys (登録商標)、ストレプトマイセス・ミクロフラブス (*Streptomyces microflavus*) NRRL B-50550 (国際公開第2014/124369号パンフレット; Bayer CropScience, Germany)、South Africaで単離されたトリコデルマ・アスペレロイデス (*Trichoderma asperelloides*) JM41R (NRRL 50759; T. フェルチル (*T. fertile*) とも呼ばれる; 例えば、BASF Agricultural Specialities (Pty) Ltd., South AfricaからのTrichoplus (登録商標)、T. ハルジアナム (*T. harzianum*) T-22 (KRL-AG2とも言われる) (ATCC 20847; BioControl 57, 687-696, 2012; 例えば、BioWorks Inc., USAからのPlantshield (登録商標) 又はAdvanced Biological Marketing Inc., Van Wert, OH, USAからのSabrex (商標))。混合物の別の実施形態によれば、少なくとも1種の殺有害生物剤IIは、L1) 群~L5) 群から選択される: L1) 殺真菌活性、殺細菌活性、殺ウイルス活性及び／又は植物防御活性剤活性を持った微生物殺有害生物剤: オーレオバシディウム・プルランス (*Aureobasidium pullulans*) DSM 14940 及び DSM 14941 (L1.1)、バチルス・アミロリクエファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*) AP-188 (L1.2)、B. アミロリクエファシエンス属プランタルム (*B. amyloliquefaciens* ssp. *plantarum*) D747 (L1.3)、B. アミロリクエファシエンス属プランタルム (*B. amyloliquefaciens* ssp. *plantarum*) FZB24 (L1.4)、B. アミロリクエファシエンス属プランタルム (*B. amyloliquefaciens* ssp. *plantarum*) FZB42 (L1.5)、B. アミロリクエファシエンス属プランタルム (*B. amyloliquefaciens* ssp. *plantarum*) MB I600 (L1.6)、B. アミロリクエファシエンス属プランタルム (*B. amyloliquefaciens* ssp. *plantarum*) QST-713 (L1.7)、B. アミロリクエファシエンス属プランタルム (*B. amyloliquefaciens* ssp. *plantarum*) TJ1000 (L1.8)、B. プミルス (*B. pumilus*) GB34 (L1.9)、B. プミルス (*B. pumilus*) GHA 180 (L1.10)、B. プミルス (*B. pumilus*) INR-7 (L.

10

20

30

40

50

1. 11)、*B. pumilus* (B. pumilus) KFP9F (L. 1. 12)、*B. pumilus* (B. pumilus) QST 2808 (L. 1. 13)、*B. シンプレックス* (*B. simplex*) ABU 288 (L. 1. 14)、*B. サブチリス* (*B. subtilis*) FB17 (L. 1. 15)、*Coniothyrus minitans* (CON/M/91-08 (L. 1. 16)、*Mettschnikowia fructicola* (NRRL Y-30752 (L. 1. 17)、*Paenibacillus alvei* (NAS6G6 (L. 1. 18)、*P. エピフィチカス* (*P. epiphyticus*) Lu17015 (L. 1. 25)、*P. ポリミキサ属* *plantarum* (P. polymyxa ssp. plantarum) Lu16774 (L. 1. 26)、*P. p. ssp. plantarum* (P. p. ssp. plantarum) 株 Lu17007 (L. 1. 27)、*Penicillium bilaiae* (ATCC 22348 (L. 1. 19)、*P. bilaiae* (P. bilaiae) (ATCC 20851 (L. 1. 20)、*Penicillium bilaiae* (ATCC 18309 (L. 1. 21)、*Streptomyces microflavus* (NRRL B-50550 (L. 1. 22)、*Trichoderma asperelloides* (JM41R (L. 1. 23)、*T. harzianum* (T-22 (L. 1. 24) ;

10

20

L2) 殺真菌活性、殺細菌活性、殺ウイルス活性及び／又は植物防御活性剤活性を持った生化学的殺有害生物剤：ハルピンタンパク質 (L. 2. 1)、*Reynoutria sachalinensis* 抽出物 (L. 2. 2) ;
L3) 殺虫活性、殺ダニ活性、殺軟体動物活性及び／又は殺線虫活性を持った微生物殺有害生物剤：*Bacillus firmus* (I-1582 (L. 3. 1)、*B. thuringiensis* ssp. *aizawai* (ABTS-1857 (L. 3. 2)、*B. t.* 亜種 *kurstaki* (ABTS-351 (L. 3. 3)、*B. t.* 亜種 *kurstaki* (SB4 (L. 3. 4)、*B. t.* 亜種 *tenebrionis* (NB-176-1 (L. 3. 5)、*Beauveria bassiana* (GHA (L. 3. 6)、*B. bassiana* (JW-1 (L. 3. 7)、*B. bassiana* (PPRI 5339 (L. 3. 8)、*Burkholderia* sp.) A396 (L. 3. 9)、*Helicoverpa armigera* 核多角体病ウイルス (HearNPV) (L. 3. 10)、*Helicoverpa zea* 核多角体病ウイルス (HzNPV) (ABA-NPV-U (L. 3. 11)、*Helicoverpa zea* 単一カブシド核多角体病ウイルス (HzSNPV) (L. 3. 12)、*Heterohabditis bacteriophora* (L. 3. 13)、*Isaria fumosorosea* (Apopka-97 (L. 3. 14)、*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae* (F52 (L. 3. 15)、*Paecilomyces lilacinus* (251 (L. 3. 16)、*Pasteuria nishizawae* (Pn1 (L. 3. 17)、*Steinernema carpocapsae* (L. 3. 18)、*S. feltiae* (L. 3. 19) ;

30

40

L4) 殺虫活性、殺ダニ活性、殺軟体動物活性、フェロモン活性及び／又は殺線虫活性を持った生化学的殺有害生物剤；*シスージャスモン* (L. 4. 1)、*ジャスモン酸メチル* (L. 4. 2)、*キラヤ* (Quillay) 抽出物 (L. 4. 3) ;

50

L 5) 植物ストレス軽減活性、植物成長調節剤活性、植物成長促進活性及び／又は収量増大活性を持った微生物殺有害生物剤：アゾスピリウム・ブラシレンセ (*Azospirillum brasilense*) Ab-V 5 及び Ab-V 6 (L. 5. 1)、A. ブラシレンセ (*A. Brasilense*) Sp 245 (L. 5. 2)、ブラジルヒゾビウム・エルカニ (*Bradyrhizobium elkanii*) SEMIA 587 (L. 5. 3)、B. エルカニ (*B. elkanii*) SEMIA 5019 (L. 5. 4)、B. ジャポニウム (*B. japonicum*) 532c (L. 5. 5)、B. ジャポニウム (*B. japonicum*) E-109 (L. 5. 6)、B. ジャポニウム (*B. japonicum*) SEMIA 5079 (L. 5. 7)、B. ジャポニウム (*B. japonicum*) SEMIA 5080 (L. 5. 8)。

10

【0229】

本発明は、更に、上記のような、少なくとも1種の化合物I (成分1) と、L) 群から選択される少なくとも1種のバイオ殺有害生物剤 (成分2)、特にL 1) 群及びL 2) 群から選択される少なくとも1種のバイオ殺有害生物剤と、必要に応じて少なくとも1種の好適な補助剤との混合物を含む農薬組成物に関する。本発明は、更に、上記のような、少なくとも1種の化合物I (成分1) と、L) 群から選択される少なくとも1種のバイオ殺有害生物剤 (成分2)、特にL 3) 及びL 4) 群から選択される少なくとも1種のバイオ殺有害生物剤と、必要に応じて少なくとも1種の好適な補助剤との混合物を含む農薬組成物に関する。

【0230】

20

殺有害生物剤II (成分2) として、L 1) 群、L 3) 群及びL 5) 群から選択される、好ましくは (L. 1. 2)、(L. 1. 3)、(L. 1. 4)、(L. 1. 5)、(L. 1. 6)、(L. 1. 7)、(L. 1. 8)、(L. 1. 10)、(L. 1. 11)、(L. 1. 12)、(L. 1. 13)、(L. 1. 14)、(L. 1. 15)、(L. 1. 17)、(L. 1. 18)、(L. 1. 19)、(L. 1. 20)、(L. 1. 21)、(L. 1. 25)、(L. 1. 26)、(L. 1. 27)、(L. 3. 1)；(L. 3. 9)、(L. 3. 16)、(L. 3. 17)、(L. 5. 1)、(L. 5. 2)、(L. 5. 3)、(L. 5. 4)、(L. 5. 5)、(L. 5. 6)、(L. 5. 7)、(L. 5. 8)；(L. 4. 2)、及び (L. 4. 1) として上に示された株から選択される；更により好ましくは (L. 1. 2)、(L. 1. 6)、(L. 1. 7)、(L. 1. 8)、(L. 1. 11)、(L. 1. 12)、(L. 1. 13)、(L. 1. 14)、(L. 1. 15)、(L. 1. 18)、(L. 1. 19)、(L. 1. 20)、(L. 1. 21)、(L. 3. 1)；(L. 3. 9)、(L. 3. 16)、(L. 3. 17)、(L. 5. 1)、(L. 5. 2)、(L. 5. 5)、(L. 5. 6)；(L. 4. 2)、及び (L. 4. 1) から選択されるバイオ殺有害生物剤を含む混合物も好ましい。これらの混合物は、特に繁殖材料の処理、すなわち種子処理目的に及び同様に土壌処理にも好適である。これらの種子処理混合物は、穀物、トウモロコシ、及びダイズなどのマメ科植物などの作物に特に好適である。

30

【0231】

殺有害生物剤II (成分2) として、L 1)、L 3) 及びL 5) 群から選択される、好ましくは (L 1. 1)、(L. 1. 2)、(L. 1. 3)、(L. 1. 6)、(L. 1. 7)、(L. 1. 9)、(L. 1. 11)、(L. 1. 12)、(L. 1. 13)、(L. 1. 14)、(L. 1. 15)、(L. 1. 17)、(L. 1. 18)、(L. 1. 22)、(L. 1. 23)、(L. 1. 24)、(L. 1. 25)、(L. 1. 26)、(L. 1. 27)、(L. 2. 2)；(L. 3. 2)、(L. 3. 3)、(L. 3. 4)、(L. 3. 5)、(L. 3. 6)、(L. 3. 7)、(L. 3. 8)、(L. 3. 10)、(L. 3. 11)、(L. 3. 12)、(L. 3. 13)、(L. 3. 14)、(L. 3. 15)、(L. 3. 18)、(L. 3. 19)；(L. 4. 2) として上に示された株から選択される；更により好ましくは (L. 1. 2)、(L. 1. 7)、(L. 1. 11)、(L. 1. 13)、(L. 1. 14)、(L. 1. 15)、(L. 1. 18)、(

40

50

L. 1. 23)、(L. 3. 3)、(L. 3. 4)、(L. 3. 6)、(L. 3. 7)、(L. 3. 8)、(L. 3. 10)、(L. 3. 11)、(L. 3. 12)、(L. 3. 15)、及び(L. 4. 2)から選択されるバイオ殺有害生物剤を含む混合物も好ましい。これらの混合物は、栽培植物の、好ましくは野菜、果物、ツル植物、穀物、トウモロコシ及びダイズなどのマメ科作物の葉面処理に特に好適である。

【0232】

有効成分の混合物を含む組成物は、通常的手段によって、例えば化合物Iの組成物に関して与えられた手段によって調製することができる。

【0233】

L1)群、L3)群及びL5)群からの殺有害生物剤IIなどの、生存微生物が組成物の一部を形成する場合、そのような組成物は、通常的手段によって調製することができる(例えば、H. D. Burges: Formulation of Microbial Biopesticides, Springer, 1998; 国際公開第2008/002371号パンフレット、米国特許第6,955,912号明細書、米国特許第5,422,107号明細書)。

10

【実施例】

【0234】

I. 合成実施例

実施例1-(8-フルオロ-3-キノリル)-(2-ニトロフェニル)メタノール

THF(200mL)中の8-フルオロ-3-ヨードキノリン(15g、0.055mol)の混合物に、N₂下に0℃でi-PrMgCl(2M)(36mL、0.0715mol)を滴加し、混合物を0℃で20分間攪拌した。次いで、THF(10mL)中の2-ニトロベンズアルデヒド(10g、0.066mol)の溶液を0℃で滴加し、混合物を20℃で16h攪拌した。反応混合物をNH₄Cl水性(200mL)でクエンチし、EtOAc(100mL)で抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウム上で乾燥させ、真空で濃縮し、残留物をシリカゲルカラム(PE:EtOAc=47%から100%)によって精製して表題化合物を緑色の固体として得た。

20

¹H NMR:(400MHz, CHLOROFORM-d):δ=3.56-3.92(m, 1H) 6.70(s, 1H) 7.37-7.43(m, 1H) 7.46-7.55(m, 2H) 7.59(d, J=8.16Hz, 1H) 7.70(td, J=7.62, 1.19Hz, 1H) 7.83(dd, J=7.91, 1.25Hz, 1H) 8.03(dd, J=8.16, 1.25Hz, 1H) 8.19(s, 1H) 8.90(d, J=2.01Hz, 1H)

30

【0235】

実施例2-(8-フルオロ-3-キノリル)-(2-ニトロフェニル)メタノール

EtOH(200mL)中の(8-フルオロ-3-キノリル)-(2-ニトロフェニル)メタノール(1.6g、5.4mmol)の溶液を、EtOH(10mL)中のRaney Ni(500mg)の混合物に添加し、混合物を、H₂(15PSi)下に20℃で2h攪拌した。反応混合物を濾過し、濾液を減圧下で濃縮し、粗生成物をMTBE(30mL)で洗浄して表題化合物を黄色の固体として得た。表題化合物を更なる精製なしにそのまま使用した。

40

¹H NMR(400MHz, CDCl₃):μ [ppm]:2.78-2.92(m, 1H) 4.01-4.17(m, 2H) 6.14(s, 1H) 6.74(d, J=8.03Hz, 1H) 6.80(t, J=7.47Hz, 1H) 7.09(br d, J=7.78Hz, 1H) 7.20(br t, J=7.78Hz, 1H) 7.39-7.44(m, 1H) 7.51(td, J=7.91, 4.89Hz, 1H) 7.62(d, J=7.91Hz, 1H) 8.21(s, 1H) 8.99(d, J=1.63Hz, 1H)。

【0236】

実施例3-(2-アミノフェニル)-(8-フルオロ-3-キノリル)メタノン

DMF(15mL)中の(8-フルオロ-3-キノリル)-(2-ニトロフェニル)メ

50

タノール（1 g、3.73 mmol）の溶液に、CuCl（37 mg、0.373 mmol）及びK₂CO₃（1.03 g、7.46 mmol）を添加し、次いで混合物を、O₂ 雰囲気下に60℃で16 h 攪拌した。反応液を塩水（100 mL）でクエンチし、EtOAc（80 mL）で抽出した。有機物を塩水（100 mL×2）で洗浄し、無水硫酸マグネシウム上で乾燥させ、真空中で濃縮した。シリカゲル上の液体クロマトグラフィー（PE：EtOAc＝約3%）による精製は、表題化合物を黄色の固体としてもたらした。

¹H NMR（400 MHz, CDCl₃）：μ [ppm]：6.03–6.34（m, 2H）6.57（ddd, J=8.06, 7.06, 1.07 Hz, 1H）6.72（dd, J=8.41, 0.75 Hz, 1H）7.29（ddd, J=8.41, 7.03, 1.51 Hz, 1H）7.37（dd, J=8.09, 1.44 Hz, 1H）7.42–7.55（m, 2H）7.65（d, J=8.03 Hz, 1H）8.37（t, J=1.76 Hz, 1H）9.13（d, J=2.13 Hz, 1H）

【0237】

実施例4-4-（8-フルオロ-3-キノリル）-2,2-ジメチル-1H-キナゾリンアセトン（10 mL）中の（2-アミノフェニル）-（8-フルオロ-3-キノリル）メタノン（700 mg、2.63 mmol）の混合物に、N₂下にNH₄OAc（1 g、13.2 mmol）及び4 Åモレキュラーシーブ（1.5 g）を添加し、混合物を60℃で2 h 攪拌した。反応混合物を濾過し、濾液をNaHCO₃水性（50 mL）、及び塩水（50 mL）で洗浄した。次いで、有機物を無水硫酸マグネシウム上で乾燥させ、真空中で濃縮した。粗生成物を、シリカゲル上の液体クロマトグラフィー（PE：EtOAc＝3：1）によって精製して表題化合物を黄色の固体として得た。

¹H NMR（400 MHz, CDCl₃）：μ [ppm]：9.02（d, J=1.88 Hz, 1H）, 8.33（br s, 1H）, 7.62（d, J=8.00 Hz, 1H）, 7.32–7.51（m, 2H）, 7.19–7.23（m, 1H）, 6.98（d, J=7.63 Hz, 1H）, 6.55–6.66（m, 2H）, 3.96–4.14（br, 1H）, 1.55（s, 6H）

【0238】

実施例5-4-（8-フルオロ-3-キノリル）-1,2,2-トリメチル-キナゾリンDMF（10 mL）中の4-（8-フルオロ-3-キノリル）-2,2-ジメチル-1H-キナゾリン（250 mg、0.82 mmol）の混合物に、N₂下に0℃でNaH（約60%）（66 mg、1.64 mmol）を添加し、混合物を0℃で0.5 h 攪拌した。次いで、ヨウ化メチル（175 mg、1.23 mmol）を添加し、混合物を20℃で16 h 攪拌した。反応混合物を塩水（50 mL）で希釈し、EtOAc（50 mL）で抽出し、合わせた有機層を塩水（80 mL×2）で洗浄し、無水硫酸マグネシウム上で乾燥させ、真空中で濃縮した。粗生成物を、シリカゲル上の液体クロマトグラフィー（PE：EtOAc＝約30%）によって精製して表題化合物を黄色の油として得た。

¹H NMR（400 MHz, CDCl₃）：μ [ppm]：9.02（d, J=1.88 Hz, 1H）, 8.31（br s, 1H）, 7.61（d, J=8.16 Hz, 1H）, 7.28–7.48（m, 3H）, 6.98（dd, J=7.65, 1.25 Hz, 1H）, 6.70（d, J=8.28 Hz, 1H）, 6.60（t, J=7.47 Hz, 1H）, 2.88（s, 3H）, 1.53（s, 6H）

【0239】

実施例6-1-〔8-フルオロ-4-（8-フルオロ-3-キノリル）-2,2-ジメチル-キナゾリン-1-イル〕エタノン

8-フルオロ-4-（8-フルオロ-3-キノリル）-2,2-ジメチル-1H-キナゾリン（200 mg、0.31 mmol）を、N₂下に25℃でAc₂O（4 mL）及びピリジン（0.2 mL）の溶液に添加し、混合物を145℃で16 h 攪拌した。反応混合物を減圧下で濃縮し、粗生成物を、シリカゲル上の高性能液体クロマトグラフィー（HPLC-カラム Kinetex XB C18 1.7 μ（50×2.1 mm）；溶離液：アセトニトリル／水（60℃において1.5分で5：95から100：0への勾配、1

10

20

30

40

50

． 5 分で 0． 8 から 1． 0 m l ／ 分 へ の フ ロー 勾 配 ） で 精 製 し て 表 題 化 合 物 を 黄 色 の 固 体 と し て 得 た。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) : μ [ppm] : 9.24 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 8.51 (s, 1H), 7.46 (t, $J = 7.7$ Hz, 1H), 7.72 (td, $J = 7.5, 8.2$ Hz, 1H), 7.61 (td, $J = 7.7, 1.4$ Hz, 2H), 7.35 (t, $J = 54.5$ Hz, 1H), 7.22 (d, $J = 7.9$ Hz, 1H), 7.13 (d, $J = 7.6$ Hz, 3H), 2.22 (s, 3H), 4.8 (s, 3H), 1.79 (s, 3H)

【0240】

表 I に 列 挙 さ れ た 化 合 物 を 類 似 し た 方 法 で 調 製 し た。

10

【0241】

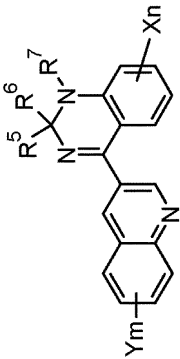
20

30

40

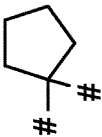
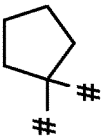
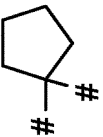
50

表1:
式Iの化合物Ex-1～Ex-13



Ex-No	R ⁵	R ⁶	Y _m	X _n	R ⁷	RT	M+H	MP (°C)
Ex-1	CH ₃	CH ₃	8-F	H	H	0.832	306.1	
Ex-2	CH ₃	CH ₃	8-F	H	CH ₃	0.855	320.1	
Ex-3	CH ₃	CH ₃	8-F	8-F	H	0.791	323.9	142

【表 1 6】

Ex-4	CH ₃	CH ₃	8-F	8-F	8-F	CH ₃	0.848	338	130
Ex-5			8-F	H	H	H	0.828	332.1	
Ex-6			8-F	H	H	CH ₃	0.857	346.1	157
Ex-7			8-F	H	H	CN	1.25	357.3	123
Ex-8	CH ₃	CH ₃	8-F	H	8-F	CN	1.136	331.1	172
Ex-9	CH ₃	CH ₃	8-F	8-F	8-F	n-ブチル	1.015	380.2	
Ex-10	CH ₃	CH ₃	8-F	8-F	8-F	エチル	0.911	352.3	158

【 0 2 4 3 】

10

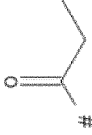
20

30

40

50

【表 1 7】

Ex-11	CH ₃	CH ₃	8-F	8-F	8-F	n-プロピル	0.972	366.3	153
Ex-12	CH ₃	CH ₃	8-F	8-F	8-Cl	H	0.865	339.9	
Ex-13	CH ₃	CH ₃	8-F	8-F	8-Cl	CH ₃	0.923	353.9	143
Ex-14	CH ₃	CH ₃	8-F	8-F	8-F	イソ-プロピル	0.949	348.0	
Ex-15	CH ₃	CH ₃	8-F	8-F	8-F		1.004	380.3	168
Ex-16	CH ₃	CH ₃	8-F	8-F	8-F		1.281	408.4	183
Ex-17	CH ₃	CH ₃	8-F	8-F	8-F	アセチル	1.091	366.3	131
Ex-18	CH ₃	CH ₃	8-F	8-F	8-F		1.175	380.3	185

【 0 2 4 4 】

10

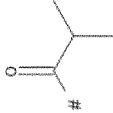
20

30

40

50

【表 1 8】

Ex-19	CH ₃	CH ₃	8-F	8-F		1.235	394.3	154
Ex-20	CH ₃	CH ₃	8-F	8-F	アセチル	1.021	348.2	163.3
Ex-21	CH ₃	CH ₃	8-F	8-F		1.123	394.0	214.7
Ex-22	CH ₃	CH ₃	8-F	8-F	CN	1.085	349.2	186
Ex-23	CH ₃	CH ₃	8-F	8-F	CN	1.251	365.1	167
Ex-24	CH ₃	CH ₃	H	8-F	H	0.805	306.2	118
Ex-25	CH ₃	CH ₃	H	8-F	CH ₃	0.855	320.2	99
Ex-26	CH ₃	CH ₃	H	8-F	CN	0.989	331.2	175

【 0 2 4 5 】

10

20

30

40

50

【表 1 9】

Ex-27	CH ₃	CH ₃	H	8-Cl	H	0.858	322.1	
Ex-28	CH ₃	CH ₃	H	8-Cl	CH ₃	0.907	336.2	116
Ex-29	CH ₃	CH ₃	8-Cl	8-F	CN	1.189	365.1	209
Ex-30	CH ₃	CH ₃	8-Cl	8-F	H	0.874	340.2	156
Ex-31	CH ₃	CH ₃	8-Cl	8-F	CH ₃	0.924	354.1	125
Ex-32	CH ₃	CH ₃	8-Cl	H	H	0.866	322.1	150
Ex-33	CH ₃	CH ₃	8-Cl	H	CH ₃	0.891	336.1	
Ex-34	CH ₃	CH ₃	8-Cl	H	CN	1.213	347.1	227

【 0 2 4 6 】

10

20

30

40

50

【表 2 0】

Ex-35	CH ₃	CH ₃	H	8-Cl	CN	1.008	347.1	233
Ex-36	CH ₃	CH ₃	8-Cl	8-Cl	H	0.934	356.1	116
Ex-37	CH ₃	CH ₃	8-CH ₃	8-F	H	0.897	320.2	167
Ex-38	CH ₃	CH ₃	8-CH ₃	8-F	CN	1.132	345.2	174
Ex-39	CH ₃	CH ₃	8-Cl	8-Cl	CH ₃	0.964	370.0	180
Ex-40	CH ₃	CH ₃	8-Cl	8-Cl	CN	1.206	381.0	241
Ex-41	CH ₃	CH ₃	7,8-F ₂	H	CH ₃	0.838	337.9	133.2
Ex-42	CH ₃	CH ₃	8-CH ₃	8-F	CH ₃	0.908	334.0	87

【 0 2 4 7 】

10

20

30

40

50

【表 2 1】

Ex-43	CH ₃	CH ₃	8-CH ₃	H	CN	1.163	327.2	146.5
Ex-44	CH ₃	CH ₃	8-CH ₃	8-Cl	H	0.946	336.2	111.5
Ex-45	CH ₃	CH ₃	8-CH ₃	8-Cl	CH ₃	0.987	350.2	113
Ex-46	CH ₃	CH ₃	8-CH ₃	8-Cl	CN	1.181	361.2	178.5
Ex-47	CH ₃	CH ₃	7,8-F ₂	H	CN	1.206	349.2	206.5
Ex-48	CH ₃	CH ₃	8-CH ₃	H	H	0.891	302.2	171
Ex-49	CH ₃	CH ₃	8-CH ₃	H	CH ₃	0.907	316.2	
Ex-49''	CH ₃	CH ₃	7,8-F ₂	H	H	0.846	324.2	83

【 0 2 4 8 】

10

20

30

40

50

【表 2 2】

Ex-50	CH ₃	CH ₃	7,8-F ₂	8-F	H	0.859	342.2	130
Ex-51	CH ₃	CH ₃	7,8-F ₂	8-Cl	H	0.927	358.1	165
Ex-52	CH ₃	CH ₃	H	H	H	0.782	387.9	103
Ex-53	CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₃	0.815	302.2	
Ex-54	CH ₃	CH ₃	H	H	CN	1.007	313.2	55.6
Ex-55	CH ₃	CH ₃	7,8-F ₂	8-F	CH ₃	0.916	356.2	142.5
Ex-56	CH ₃	CH ₃	7,8-F ₂	8-F	CN	1.171	367.2	190
Ex-57	CH ₃	CH ₃	7,8-F ₂	8-Cl	CH ₃	0.973	371.8	181

【 0 2 4 9】

10

20

30

40

50

【表 2 3】

Ex-58	CH ₃	CH ₃	7,8-F ₂	8-Cl	CN	1.198	382.8	240
Ex-59	CH ₃	イソプロピル	8-F	H	H	0.868	333.9	80
Ex-60	CH ₃	CH ₃	8-F	H		0.937	360.0	
Ex-61	(CH ₂) ₃		8-F	8-F	CH ₃	0.911	349.9	
Ex-62	CH ₃	4-F-フェニル	8-F	H	H	0.935	385.9	101.5
Ex-63	CH ₃	CH ₃	H	7,8-F ₂	H	0.710	323.8	180
Ex-64	CH ₃	CH ₃	H	7,8-F ₂	CH ₃	0.775	337.9	103
Ex-65	CH ₃	イソプロピル	8-F	H	CN	1.281	358.9	251

【 0 2 5 0 】

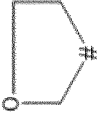
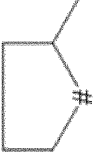
10

20

30

40

【表 2 4】

Ex-66	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	8-F	H	H	CN	0.835	349.9	
Ex-67			8-F	H	H	CN	0.782	333.8	99
Ex-68	CH ₃	4-F-フェニル	8-F	H	H	CN	1.273	410.9	
Ex-69	CH ₃	CH ₂ CF ₃	8-F	H	H	CN	1.216	399.2	
Ex-70	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	8-F	H	H	CN	1.150	375.2	
Ex-71			8-F	H	H	H	0.945	359.9	135
Ex-72			8-F	H	H	H	0.897	346.2	
Ex-73	CH ₃	4-F-ベンジル	8-F	H	H	CN	1.305	425.3	

【 0 2 5 1 】

10

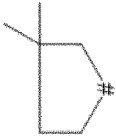
20

30

40

50

【表 2 5】

Ex-74	CH ₃	CH ₃	H	7,8-F ₂	CN	0.889	349.2	186
Ex-75	CH ₃	CH ₃	8-F	7,8-F ₂	H	0.864	342.2	122
Ex-76	CH ₃	CH ₃	8-F	7,8-F ₂	CH ₃	0.925	356.2	122
Ex-77			8-F	H	CN	1.076	359.2	94
Ex-78			8-F	H	CN	1.380	385.1	140.7
Ex-79	CH ₃	CH ₂ F	8-F	H	H	0.814	323.8	
Ex-80	CH ₃	CH ₃	8-F	H		0.888	346.0	
Ex-81	CH ₃	CH ₃	8-F	8-F		0.953	363.9	159

【 0 2 5 2 】

10

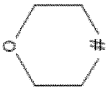
20

30

40

50

【表 2 6】

Ex-82	CH ₃	CH ₂ F	8-F	H	CN	1.123	348.8	214.5
Ex-83	エチル	エチル	8-F	H	H	0.876	334.2	
Ex-84	(CH ₂) ₅		8-F	H	H	0.886	346.0	
Ex-85			8-F	H	H	0.801	348.2	
Ex-86	CH ₃	CH ₃	8-F	7,8-F ₂	CN	1.153	367.2	199.6
Ex-87	CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ , 8-F	8-F	H	0.840	338.2	158.8
Ex-88	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	8-F	H	0.893	334.3	
Ex-89	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	8-F	CN	1.279	358.9	

【 0 2 5 3】

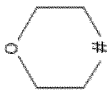
10

20

30

40

【表 2 7】

372.8	371	371
1.122	1.349	1.341
CN	CN	CN
8-F	8-F	8-F
H	H	H
		
Ex-90	Ex-91	Ex-92

【0 2 5 4】

温室

化合物を、9 9 対 1 の溶媒－乳化剤比率（体積）での、アセトン及び／又はジメチルスルホキシドと、エトキシル化アルキルフェノールをベースとする、湿潤剤／乳化剤 W e t t o l との混合物に溶解させて 5 m l の全量にした。その後、水を添加して 1 0 0 m l の全量にした。

【0 2 5 5】

次いで、この原液を、記載された溶媒－乳化剤－水混合液で希釈して以下の表に示される最終濃度にした。

【0256】

実施例1ーピーマンの葉に係るボトリティス・シネレア (*Botrytis cinerea*) の予防的殺真菌防除

ピーマンの稚苗をポットで4～5葉期まで生育させた。これらの植物に、下表に挙げられる有効成分又は混合物の濃縮物を含有する、既述の噴霧溶液を流れ落ちるまで噴霧した。翌日、植物にボトリティス・シネレア (*Botrytis cinerea*) の芽胞懸濁液を含有するバイオモルト水溶液又はDOB水溶液を接種した。次いで、植物を直ちに加湿室に移した。22～24℃及び飽和相対湿度で5日後に、葉への真菌の攻撃の程度を%罹病葉面積として目視評価した。

【0257】

この試験において、未処理の植物は80%感染したのに対して、実施例Ex-2、Ex-3、Ex-4、Ex-6、Ex-7、Ex-8、Ex-9、Ex-10、Ex-11、Ex-12、Ex-13、Ex-14、Ex-15、Ex-18、Ex-20、Ex-22、Ex-23、Ex-25、Ex-26、Ex-28、Ex-31、Ex-39、Ex-42、Ex-43、Ex-45、Ex-46、Ex-47、Ex-54、Ex-55、Ex-60、Ex-61、Ex-65及びEx-76からの250ppmの活性物質で処理された試料は、それぞれ、最大でも13%以下の病原体の増殖を示した。

【0258】

実施例2ースクレロチニア・スクレロチオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*) SCL ESC P1 OSRによって引き起こされるナタネに係る白かび病の予防的殺菌防除

ナタネをポットで13～14葉期まで生育させた。これらの植物に、下表に挙げられる有効成分又はそれらの混合物の濃縮物を含有する、既述の噴霧溶液を流れ落ちるまで噴霧した。

【0259】

植物は風乾させることができた。翌日、適用されたナタネ花びらに、葉上に25μlの2.5%メチルセルロースを固定し、1及び2.25μlのスクレロチニア・スクレロチオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*) の芽胞懸濁液を、各固定ナタネ花びら上にピペットで移した。20℃及び60%の相対湿度で14日後に、葉への真菌の攻撃の程度を%罹病葉面積として目視評価した。

【0260】

この試験において、未処理の植物は80%感染したのに対して、実施例Ex-2、Ex-3、Ex-4、Ex-6、Ex-7、Ex-8、Ex-9、Ex-10、Ex-11、Ex-12、Ex-13、Ex-15、Ex-22、Ex-25、Ex-26からの100g/haの活性物質で処理された試料は、それぞれ、最大でも12%以下の病原体の増殖を示した。

【0261】

実施例3ースクレロチニア・スクレロチオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*) (SCL ESC P1) によって引き起こされるダイズに係る白かび病の予防的殺菌防除

ダイズの稚苗をポットで生育させた。これらの植物に、下表に挙げられる有効成分又は混合物の濃縮物を含有する、既述の噴霧溶液を流れ落ちるまで噴霧した。翌日、処理された植物に、スクレロチニア・スクレロチオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*) の菌糸体を含有する、バイオモルト懸濁液を接種した。次いで、試行植物を、23℃並びに80及び85%の相対湿度での温室中で6日間栽培した。葉への真菌の攻撃の程度を%罹病葉面積として目視評価した。

【0262】

この試験において、未処理の植物は80%感染したのに対して、実施例Ex-8、Ex-11、Ex-13、Ex-14、Ex-22、Ex-25、Ex-26、Ex-28、Ex-31、Ex-39、Ex-42、Ex-43、Ex-45、Ex-47、Ex-5

10

20

30

40

50

5、Ex-60、Ex-65、Ex-76及びEx-77からの250ppmの活性物質で処理された試料は、それぞれ、最大でも15%以下の病原体の増殖を示した。

【0263】

マイクロテスト

活性化合物を、ジメチルスルホキシド中に10000ppmの濃度を有する原液として別々に配合した。

【0264】

原液を比率に従って混合し、マイクロタイタープレート（MTP）上へピペットで移し、水で記述の濃度に希釈した。

【0265】

実施例1－マイクロタイタープレート試験における灰色かび病菌ボトリティス・シネレア（*Botrytis cinerea*）に対する活性

バイオモルト水溶液又は酵母－バクトペプトン－酢酸ナトリウム水溶液中のボトルチ・シネレア（*Botrytis cinerea*）の芽胞懸濁液を次いで添加した。

【0266】

この試験において、実施例Ex-1、Ex-2、Ex-3、Ex-4、Ex-5、Ex-6、Ex-7、Ex-8、Ex-9、Ex-10、Ex-11、Ex-12、Ex-13、Ex-14、Ex-15、Ex-16、Ex-17、Ex-18、Ex-19、Ex-20、Ex-21、Ex-22、Ex-23、Ex-24、Ex-25、Ex-26、Ex-27、Ex-28、Ex-29、Ex-30、Ex-31、Ex-32、Ex-33、Ex-34、Ex-35、Ex-36、Ex-37、Ex-38、Ex-39、Ex-40、Ex-41、Ex-42、Ex-43、Ex-44、Ex-45、Ex-46、Ex-47、Ex-48、Ex-49、Ex-49'、Ex-50、Ex-51、Ex-52、Ex-53、Ex-54、Ex-55、Ex-56、Ex-57、Ex-58、Ex-59、Ex-60、Ex-61、Ex-62、Ex-63、Ex-64、Ex-65、Ex-66、Ex-67、Ex-68からの31ppmの活性物質で処理された試料は、それぞれ、14%以下の病原体の増殖を示した。

【0267】

実施例2－マイクロタイタープレート試験におけるフザリウム・クルモルム（*Fusarium culmorum*）に対する活性

バイオモルト水溶液又は酵母－バクトペプトン－グリセリン又はDOB水溶液中のフザリウム・クルモルム（*Fusarium culmorum*）の芽胞懸濁液を次いで添加した。

【0268】

この試験において、実施例Ex-6、Ex-7、Ex-8、Ex-10及びEx-11からの8ppmの活性物質で処理された試料は、それぞれ、1%以下の病原体の増殖を示した。

【0269】

この試験において、実施例Ex-2、Ex-3、Ex-4、Ex-6、Ex-7、Ex-8、Ex-10、Ex-11、Ex-12、Ex-13、Ex-14、Ex-17、Ex-18、Ex-19、Ex-20、Ex-22、Ex-23、Ex-25、Ex-26、Ex-27、Ex-28、Ex-29、Ex-30、Ex-31、Ex-33、Ex-34、Ex-35、Ex-36、Ex-37、Ex-38、Ex-39、Ex-40、Ex-41、Ex-42、Ex-43、Ex-44、Ex-45、Ex-46、Ex-47、Ex-49、Ex-50、Ex-51、Ex-53、Ex-54、Ex-55、Ex-57、Ex-60、Ex-61、Ex-62、Ex-64、Ex-65、Ex-67、Ex-68からの31ppmの活性物質で処理された試料は、それぞれ、20%以下の病原体の増殖を示した。

【0270】

実施例3－セプトリア・トリチシ（*Septoria tritici*）によって引き起

10

20

30

40

50

こされるコムギに係る葉枯病に対する活性

バイオモルト水溶液又は酵母－バクトペプトン－グリセリン又はDOB水溶液中のセプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) の芽胞懸濁液を次いで添加した。
【0271】

この試験において、実施例 Ex-6、Ex-7、Ex-8、Ex-9、Ex-10及びEx-11からの8ppmの活性物質で処理された試料は、それぞれ、19%の病原体の増殖を示した。

【0272】

この試験において、実施例 Ex-2、Ex-3、Ex-4、Ex-6、Ex-7、Ex-9、Ex-10、Ex-11、Ex-12、Ex-13、Ex-14、Ex-17、Ex-18、Ex-19、Ex-20、Ex-23、Ex-25、Ex-26、Ex-27、Ex-28、Ex-31、Ex-35、Ex-36、Ex-39、Ex-41、Ex-42、Ex-44、Ex-45、Ex-49、Ex-50、Ex-51、Ex-55、Ex-57、Ex-59、Ex-60、Ex-61からの31ppmの活性物質で処理された試料は、それぞれ、18%以下の病原体の増殖を示した。

10

【0273】

測定されたパラメータを、活性化合物を含まない対照異形 (100%) 及び真菌を含まないブランク値の増殖と比較してそれぞれの活性化合物における病原体の%単位での相対増殖を決定した。

【0274】

20

実施例4－マイクロタイタープレート試験における灰色かび病菌イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) に対する活性

バイオモルト水溶液又は酵母－バクトペプトン－酢酸ナトリウム水溶液中のイネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) の芽胞懸濁液を次いで添加した。

【0275】

この試験において、実施例 Ex-1、Ex-2、Ex-3、Ex-4、Ex-6、Ex-7、Ex-8、Ex-9、Ex-10、Ex-11、Ex-13、Ex-14、Ex-15、Ex-16、Ex-17、Ex-18、Ex-19、Ex-20、Ex-22、Ex-23、Ex-29からの31ppmの活性物質で処理された試料は、それぞれ、20%以下の病原体の増殖を示した。

30

【0276】

実施例5－マイクロタイタープレート試験における灰色かび病菌セルコスポラ・ベチコラ (*Cercospora beticola*) に対する活性

バイオモルト水溶液又は酵母－バクトペプトン－酢酸ナトリウム水溶液中のセルコスポラ・ベチコラ (*Cercospora beticola*) の芽胞懸濁液を次いで添加した。

【0277】

この試験において、実施例 Ex-4、Ex-6、Ex-10、Ex-12、Ex-13、Ex-14、Ex-17、Ex-18、Ex-19、Ex-25、Ex-26からの31ppmの活性物質で処理された試料は、それぞれ、20%以下の病原体の増殖を示した。

40

【0278】

実施例6－マイクロタイタープレート試験における灰色かび病菌セルコスポラ・ソジナ (*Cercospora soja*) に対する活性

バイオモルト水溶液又は酵母－バクトペプトン－酢酸ナトリウム水溶液中のセルコスポラ・ソジナ (*Cercospora soja*) の芽胞懸濁液を次いで添加した。

【0279】

この試験において、実施例 Ex-2、Ex-3、Ex-4、Ex-6、Ex-9、Ex-10、Ex-11、Ex-12、Ex-13、Ex-14、Ex-17、Ex-18、Ex-19、Ex-26からの31ppmの活性物質で処理された試料は、それぞれ、1

50

2 % 以下の病原体の増殖を示した。

【0280】

実施例7－マイクロタイタープレート試験における灰色かび病菌セルコスプラ・ゼアエ・マイディス (*Cercospora zeae maydis*) に対する活性

バイオモルト水溶液又は酵母－バクトペプトン－酢酸ナトリウム水溶液中のセルコスプラ・ゼアエ・マイディス (*Cercospora zeae maydis*) の芽胞懸濁液を次いで添加した。

【0281】

この試験において、実施例 Ex-4、Ex-8、Ex-11、Ex-13、Ex-14、Ex-18、Ex-22、Ex-25、Ex-26 から 31 ppm の活性物質で処理された試料は、それぞれ、17 % 以下の病原体の増殖を示した。

10

【0282】

実施例8－マイクロタイタープレート試験における灰色かび病菌コリネスポラ・カッシイコラ (*Corynespora cassiicola*) G413A 突然変異体に対する活性

バイオモルト水溶液又は酵母－バクトペプトン－酢酸ナトリウム水溶液中のコリネスポラ・カッシイコラ (*Corynespora cassiicola*) の芽胞懸濁液を次いで添加した。

【0283】

この試験において、実施例 Ex-1、Ex-2、Ex-4、Ex-5、Ex-6、Ex-7、Ex-8、Ex-10、Ex-11、Ex-12、Ex-13、Ex-14、Ex-15、Ex-16、Ex-17、Ex-18、Ex-19、Ex-20、Ex-22、Ex-23、Ex-25、Ex-26、Ex-27、Ex-28、Ex-29、Ex-30、Ex-31、Ex-32、Ex-33、Ex-34、Ex-35、Ex-36、Ex-37、Ex-38、Ex-39、Ex-40、Ex-41、Ex-42、Ex-43、Ex-44、Ex-45、Ex-46、Ex-47、Ex-48、Ex-49、Ex-49'、Ex-50、Ex-51、Ex-52、Ex-53、Ex-54、Ex-55、Ex-56、Ex-57、Ex-58、Ex-59、Ex-60、Ex-61、Ex-62、Ex-63、Ex-64、Ex-65、Ex-66、Ex-67、Ex-68 からの 31 ppm の活性物質で処理された試料は、それぞれ、17 % 以下の病原体の増殖を示した。

20

30

40

50

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2022/070787

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D401/04 A01N43/54 ADD.		
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) C07D A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP 2011 148714 A (NIPPON SODA CO) 4 August 2011 (2011-08-04) cited in the application The whole document. In particular claim 1; and pages 44-51, 53-63: examples IIa-1 to IIIf-34. -----	1-11
☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☒ See patent family 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 application or patent 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 October 2022		Date of mailing of the international search report 28/10/2022
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Weisbrod, Thomas

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT			
Information on patent family members			International application No PCT/EP2022/070787
Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
JP 2011148714 A 04-08-2011 NONE			

フロントページの続き

MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,N
E,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,
CV,CZ,DE,DJ,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IQ,IR,IS,IT,J
M,JO,JP,KE,KG,KH,KN,KP,KR,KW,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,MY
,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,ST,SV,SY,T
H,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,WS,ZA,ZM,ZW

ィヒスハーフェン, カーラーボッシュシュートラーセ 3 8

(72)発明者 ミューラー, ベルント

ドイツ連邦共和国 6 7 2 2 7 フランケンタール, シュトッキンガー シュートラーセ 7

(72)発明者 ゼーベルガー, フィリップ ゲオルク ヴェルナー

ドイツ連邦共和国 6 7 0 5 6 ルートヴィヒスハーフェン, カーラーボッシュシュートラーセ 3 8

(72)発明者 マーゲット, ベンヤミン ユルゲン

ドイツ連邦共和国 6 7 0 5 6 ルートヴィヒスハーフェン, カーラーボッシュシュートラーセ 3 8

(72)発明者 スターサー, ティム アレクサンダー

ドイツ連邦共和国 6 7 0 5 6 ルートヴィヒスハーフェン, カーラーボッシュシュートラーセ 3 8

(72)発明者 ル ヴェゾウエ, ロナン

ドイツ連邦共和国 6 7 0 5 6 ルートヴィヒスハーフェン, カーラーボッシュシュートラーセ 3 8

(72)発明者 ローマン, ヤン クラース

ドイツ連邦共和国 6 7 0 5 6 ルートヴィヒスハーフェン, カーラーボッシュシュートラーセ 3 8

(72)発明者 ツィーグラ, ドロテー ゾフィーア

ドイツ連邦共和国 6 7 0 5 6 ルートヴィヒスハーフェン, カーラーボッシュシュートラーセ 3 8

(72)発明者 ミナカー, アミン

ドイツ連邦共和国 6 7 0 5 6 ルートヴィヒスハーフェン, カーラーボッシュシュートラーセ 3 8

(72)発明者 リーディガー, ナディーン

ドイツ連邦共和国 6 7 1 1 7 リンブルガーホーフ, シュパイヤラー シュートラーセ 2

(72)発明者 コッホ, アンドレアス

ドイツ連邦共和国 6 7 1 1 7 リンブルガーホーフ, シュパイヤラー シュートラーセ 2

F ターム (参考) 4H011 AA03 BB09 DA16 DD03 DD04