

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2019-516670

(P2019-516670A)

(43) 公表日 令和1年6月20日(2019.6.20)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
CO7D 271/06 (2006.01)	CO7D 271/06 CSP	2B051
CO7D 413/12 (2006.01)	CO7D 413/12	4C056
AO1N 43/836 (2006.01)	AO1N 43/836	4C063
AO1N 47/40 (2006.01)	AO1N 47/40 Z	4H011
AO1N 47/12 (2006.01)	AO1N 47/12 IO2	
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求		(全 99 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2018-553448 (P2018-553448)
 (86) (22) 出願日 平成29年4月12日 (2017. 4. 12)
 (85) 翻訳文提出日 平成30年10月11日 (2018. 10. 11)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2017/058839
 (87) 国際公開番号 W02017/178549
 (87) 国際公開日 平成29年10月19日 (2017. 10. 19)
 (31) 優先権主張番号 201611012875
 (32) 優先日 平成28年4月12日 (2016. 4. 12)
 (33) 優先権主張国 インド (IN)

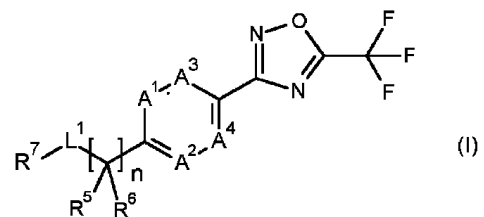
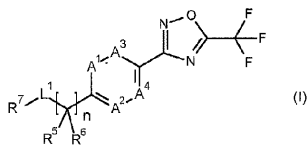
(71) 出願人 300091441
 シンジェンタ パーティシペーションズ
 アーゲー
 スイス国4058 バーゼル、シュバルツ
 バルトアレー 215
 (74) 代理人 100094569
 弁理士 田中 伸一郎
 (74) 代理人 100088694
 弁理士 弟子丸 健
 (74) 代理人 100103610
 弁理士 ▲吉▼田 和彦
 (74) 代理人 100084663
 弁理士 箱田 篤
 (74) 代理人 100093300
 弁理士 浅井 賢治

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 殺微生物性オキサジアゾール誘導体

(57) 【要約】

有害生物防除剤、特に、殺菌剤として有用な、式(I)の化合物



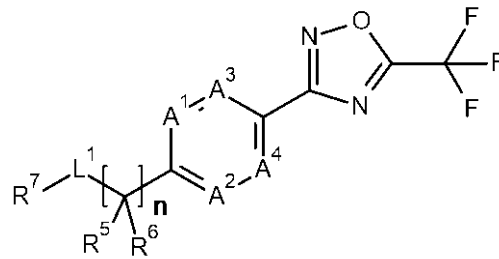
(式中、置換基は、請求項1に定義されているとおりである)。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物：

【化 1】



(I)

10

(式中、

A^1 は N または CR^1 を表し、ここで、 R^1 は、水素、ハロゲン、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシまたはジフルオロメトキシを表し；

A^2 は N または CR^2 を表し、ここで、 R^2 は、水素、ハロゲン、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシまたはジフルオロメトキシを表し；

A^3 は N または CR^3 を表し、ここで、 R^3 は水素またはフルオロを表し；

20

A^4 は N または CR^4 を表し、ここで、 R^4 は水素またはフルオロを表し；ならびにここで、 $A^1 \sim A^4$ のうち N であるのは 2 つ以下であり；

R^5 および R^6 は、水素、ハロゲン、シアノ、メチル、エチル、メトキシもしくは C_{1-2} ハロアルキルから独立して選択され；または

R^5 および R^6 は、これらが結合している炭素原子と一緒に、 C_{3-6} シクロアルキル環を形成し；

n は 1 または 2 であり；

L^1 は、 $-O-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-(R^8)NC(O)O-$ または $-(R^{10})C=N-O-$ を表し；

R^7 は、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-6} アルキニル、シアノ C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{3-6} ハロアルケニル、ヒドロキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-2} ハロアルコキシ C_{1-6} アルキルもしくは $-CH=N-O-C_{1-4}$ アルキルを表し；または

30

R^7 は、 C_{3-8} シクロアルキル (ここで、該シクロアルキル部分は部分的に不飽和であってもよい)、フェニル、炭素原子を介して L^1 に結合したヘテロアリール (ここで、該ヘテロアリール部分は、N、O および S から独立して選択される 1、2、3 もしくは 4 個のヘテロ原子を含む 5 員もしくは 6 員単環式芳香族環である)、炭素原子を介して L^1 に結合したヘテロシクリル (ここで、該ヘテロシクリル部分は、N、O および S から独立して選択される 1、2 もしくは 3 個のヘテロ原子を含む 4 員 ~ 6 員非芳香族環である) を表し、ここで、 C_{3-8} シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルは、

40

R^9 から選択される同一であっても異なってもよい 1、2 もしくは 3 個の置換基で置換されていてもよく；

または、ここで、 R^7 が C_{3-8} シクロアルキルまたはヘテロシクリルを表す場合、該 C_{3-8} シクロアルキル部分または該ヘテロシクリル部分は、1 もしくは 2 個のオキシ基で置換されていてもよく；

R^8 は、水素、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシまたはメチルカルボニルを表し；

R^9 は、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} ハロアルコキシ、 C_{1-4} アルキルカルボニル、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 C_{1-4} アルキルアミノカルボニル、ジ C_{1-4} アルキルアミノカルボニルを表し；ならびに

50

R^{10} は C_{1-4} アルキルであり；または

L^1 が $-C(O)O-$ または $-(R^{10})C=N-O-$ である場合、 R^7 は窒素原子を含むヘテロシクリル環であり得、ここで、該ヘテロシクリルは窒素原子を介して L^1 に結合しており、および、該ヘテロシクリル部分は、N、OまたはSから選択される追加のヘテロ原子を含んでもよい4員～6員非芳香族環であり、および、該ヘテロシクリルは、 R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基で置換されていてもよく；または

L^1 が $-(R^{10})C=N-O-$ である場合、 R^7 は窒素原子を含むヘテロアリアル環であり得、ここで、該ヘテロアリアルは窒素原子を介して L^1 に結合しており、および、該ヘテロアリアル部分は、追加の1もしくは2個の窒素原子を含んでもよい5員もしくは6員単環式芳香族環であり、および、該ヘテロアリアルは、 R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基で置換されていてもよく；または

L^1 が $-(R^{10})C=N-O-$ である場合、 R^7 および R^{10} は、これらが結合している炭素原子と一緒に、部分的に不飽和もしくは完全不飽和であってもよく、および、1もしくは2個の窒素原子を含有してもよい4員、5員もしくは6員環を形成し得、ここで、前記環は、 R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基で置換されていてもよく、および、 $C(O)$ または $S(O)_2$ から選択される1個の基をさらに含有していてもよい)、またはその塩もしくはN-オキシド。

【請求項2】

A^1 がNまたは CR^1 を表し、ここで、 R^1 が、水素、ハロゲンまたはメチルから選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

A^2 がNまたは CR^2 を表し、ここで、 R^2 が、水素、ハロゲンまたはメチルから選択される、請求項1または請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

A^1 、 A^2 、 A^3 および A^4 がC-Hである、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項5】

R^5 および R^6 の各々が、独立して、水素、メトキシまたは C_{1-2} ハロアルキルを表す、請求項1～4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

R^7 が：

(i) C_{1-6} アルキルもしくは C_{1-4} ハロアルキル；または

(ii) R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基で置換されていてもよい、 C_{3-6} シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリアルもしくはヘテロシクリル

を表す、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項7】

R^7 が、メチル、エチル、イソプロピル、*t*-ブチル、2,2,2-トリフルオロエチル、シクロプロピル、フェニル、ピリジニル、ピリダジニル、イソオキサゾリル、ジヒドロイソキサゾリル、テトラゾリル、ピラゾリル、オキサジアゾリルまたはモルホリニルを表し、ここで、フェニル、ピリジニル、ピリダジニル、イソオキサゾリル、ジヒドロイソキサゾリル、テトラゾリル、ピラゾリルおよびオキサジアゾリルが、 R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基で置換されていてもよい、請求項1～6のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項8】

L^1 が $-O-$ または $-C(O)O-$ を表す、請求項1～7のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項9】

10

20

30

40

50

R⁹が、シアノ、ハロゲン、C₁₋₄アルキルまたはC₁₋₄ハロアルキルを表す、請求項1～8のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項10】

R⁹が、シアノ、フルオロ、メチルまたはトリフルオロメチルを表す、請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項11】

nが1である、請求項1～10のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項12】

殺菌的に有効な量の請求項1～11のいずれか一項に記載の式(I)の化合物を含む農芸化学組成物。

10

【請求項13】

少なくとも1種の追加の活性成分および/または農芸化学的に許容可能な希釈剤またはキャリアをさらに含む、請求項12に記載の組成物。

【請求項14】

植物病原性微生物による有用な植物の外寄生を防除または予防する方法であって、殺菌的に有効な量の請求項1～11のいずれかに記載の式(I)の化合物、または活性成分として当該化合物を含む組成物が、前記植物、その一部またはその生息地に適用される方法。

【請求項15】

殺菌剤としての、請求項1～11のいずれか一項に記載の式(I)の化合物の使用。

20

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、例えば、殺微生物活性、特に殺菌(fungicidal)活性を有する活性成分としての殺微生物性オキサジアゾール誘導体に関する。本発明はまた、少なくとも1種のオキサジアゾール誘導体を含む農芸化学組成物、これらの化合物の調製プロセス、および、農業または園芸における、植物、収穫された食品作物、種子または非生体材料に対する特に真菌(fungi)といった植物病原性微生物による外寄生(infestation)を防除もしくは予防するためのオキサジアゾール誘導体または組成物の使用に関する。

【背景技術】

30

【0002】

フェニルオキサジアゾール誘導体は、国際公開第1994/05153号および欧州特許第0 276 432号明細書から公知である。国際公開第2015/185485号には、植物病原性真菌を駆除するための置換オキサジアゾールの使用が記載されている。

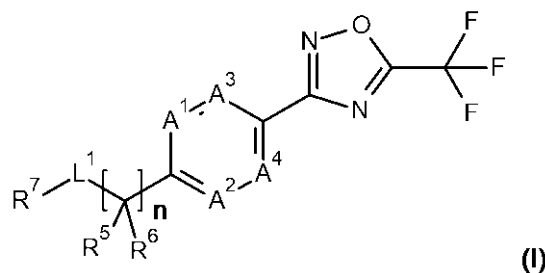
【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0003】

本発明によれば、式(I)の化合物：

【化1】



(I)

40

(式中、

A¹はNまたはCR¹を表し、ここで、R¹は、水素、ハロゲン、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシまたはジフルオロメトキシを表

50

し；

A^2 はNまたは CR^2 を表し、ここで、 R^2 は、水素、ハロゲン、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシまたはジフルオロメトキシを表し；

A^3 はNまたは CR^3 を表し、ここで、 R^3 は水素またはフルオロを表し；

A^4 はNまたは CR^4 を表し、ここで、 R^4 は水素またはフルオロを表し；ならびにここで、 $A^1 \sim A^4$ のうちNであるのは2つ以下であり；

R^5 および R^6 は、水素、ハロゲン、シアノ、メチル、エチル、メトキシもしくは C_{1-2} ハロアルキルから独立して選択され；または

R^5 および R^6 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 C_{3-6} シクロアルキル環を形成し；

nは1または2であり；

L^1 は、 $-O-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-(R^8)NC(O)O-$ または $-(R^{10})C=N-O-$ を表し；

R^7 は、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-6} アルキニル、シアノ C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{3-6} ハロアルケニル、ヒドロキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-2} ハロアルコキシ C_{1-6} アルキルもしくは $-CH=N-O-C_{1-4}$ アルキルを表し；または

R^7 は、 C_{3-8} シクロアルキル（ここで、該シクロアルキル部分は部分的に不飽和であってもよい）、フェニル、炭素原子を介して L^1 に結合したヘテロアリール（ここで、該ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1、2、3もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員単環式芳香族環である）、炭素原子を介して L^1 に結合したヘテロシクリル（ここで、該ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1、2もしくは3個のヘテロ原子を含む4員～6員非芳香族環である）を表し、ここで、 C_{3-8} シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルは、 R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基で任意選択により置換されていてもよく；

ここで、 R^7 が C_{3-8} シクロアルキルまたはヘテロシクリルを表す場合、該 C_{3-8} シクロアルキル部分またはヘテロシクリル部分は、1もしくは2個のオキソ基で任意選択により置換されていてもよく；

R^8 は、水素、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシまたはメチルカルボニルを表し；

R^9 は、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} ハロアルコキシ、 C_{1-4} アルキルカルボニル、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 C_{1-4} アルキルアミノカルボニル、ジ C_{1-4} アルキルアミノカルボニルを表し；ならびに

R^{10} は C_{1-4} アルキルであり；または

L^1 が $-C(O)O-$ または $-(R^{10})C=N-O-$ である場合、 R^7 は窒素原子を含むヘテロシクリル環であり得、ここで、該ヘテロシクリルは窒素原子を介して L^1 に結合しており、および、該ヘテロシクリル部分は、N、OまたはSから選択される追加のヘテロ原子を含んでもよい4員～6員非芳香族環であり、および、該ヘテロシクリルは、 R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基で任意選択により置換されていてもよく；または

L^1 が $-(R^{10})C=N-O-$ である場合、 R^7 は窒素原子を含むヘテロアリール環であり得、ここで、該ヘテロアリールは窒素原子を介して L^1 に結合しており、および、該ヘテロアリール部分は、追加の1もしくは2個の窒素原子を含んでもよい5員もしくは6員単環式芳香族環であり、および、該ヘテロアリールは、 R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基で任意選択により置換されていてもよく；または

L^1 が $-(R^{10})C=N-O-$ である場合、 R^7 および R^{10} は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、部分的に不飽和もしくは完全不飽和であってもよく、および、1

10

20

30

40

50

もしくは2個の窒素原子を含有してもよい4員、5員もしくは6員環を形成し得、ここで、環は、R⁹から選択される同一であっても異なっていてもよい1、2もしくは3個の置換基で任意選択により置換されていてもよく、および、任意選択により、C(O)またはS(O)₂から選択される1個の基をさらに含有していてもよい) ; またはその塩もしくはN-オキシドが提供される。

【0004】

意外なことに、式(I)の新規な化合物が、實際上、真菌によって引き起こされる病害に対する植物の保護に係る非常に有利なレベルの生物学的活性を有することが見出された。

【発明を実施するための形態】

10

【0005】

本発明の第2の態様によれば、殺菌的に有効な量の式(I)の化合物を含む農芸化学組成物が提供される。このような農業用組成物は、少なくとも1種の追加の活性成分および/または農芸化学的に許容可能な希釈剤またはキャリアをさらに含み得る。

【0006】

本発明の第3の態様によれば、植物病原性微生物による有用な植物の外寄生を防除または予防する方法であって、殺菌的に有効な量の式(I)の化合物、または活性成分としてこの化合物を含む組成物が、植物、その一部またはその生息地に適用される方法が提供される。

【0007】

20

本発明の第4の態様によれば、殺菌剤(殺真菌剤)(fungicide)としての式(I)の化合物の使用が提供される。本発明のこの特定の態様によれば、使用は、手術もしくは治療によるヒトもしくは動物の身体の処置法を除外し得る。

【0008】

本明細書において用いられるところ、「ハロゲン」または「ハロ」という用語は、フッ素(フルオロ)、塩素(クロロ)、臭素(プロモ)またはヨウ素(ヨード)、好ましくはフッ素、塩素または臭素を指す。

【0009】

本明細書において用いられるところ、シアノは-CN基を意味する。

【0010】

30

本明細書において用いられるところ、ヒドロキシは-OH基を意味する。

【0011】

本明細書において用いられるところ、オキソは=O基(例えば、カルボニル(C=O)基におけるとおり)を意味する。

【0012】

本明細書において用いられるところ、アシルは-C(O)CH₃基を意味する。

【0013】

本明細書において用いられるところ、「C₁₋₆アルキル」という用語は、炭素および水素原子のみからなり、不飽和を含まず、1~6個の炭素原子を有し、かつ、単結合によって分子の残部に結合された直鎖または分岐鎖の炭化水素鎖ラジカルを指す。C₁₋₄アルキルおよびC₁₋₃アルキルという用語は相応に解釈されるべきである。C₁₋₆アルキルの例としては、これらに限定されないが、メチル、エチル、n-プロピル、1-メチルエチル(イソ-プロピル)、n-ブチルおよび1-ジメチルエチル(t-ブチル)が挙げられる。「C₁₋₆アルキレン」基は、C₁₋₆アルキル(およびC₁₋₄アルキルおよびC₁₋₂アルキル)の対応する定義を指すが、ただし、このようなラジカルは2つの単結合によって分子の残部に結合されている。C₁₋₆アルキレンの例としては、これらに限定されないが、-CH₂-、-CH₂CH₂-および-(CH₂)₃-が挙げられる。

40

【0014】

本明細書において用いられるところ、「C₁₋₆アルコキシ」という用語は式-OR_aのラジカルを指し、ここで、R_aは、一般に上記に定義されているC₁₋₆アルキルラジカルで

50

ある。C₁₋₄アルコキシおよびC₁₋₂アルコキシは相応に解釈されるべきである。C₁₋₆アルコキシの例としては、これらに限定されないが、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソ-プロポキシ、t-ブトキシが挙げられる。

【0015】

本明細書において用いられるところ、「C₁₋₆ハロアルキル」という用語は、一般に上記に定義されているとおり、1個以上の同一または異なるハロゲン原子によって置換されているC₁₋₆アルキルラジカルを指す。C₁₋₆ハロアルキルの例としては、これらに限定されないが、クロロメチル、フルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチルが挙げられる。C₁₋₄ハロアルキルおよびC₁₋₂ハロアルキルは相応に解釈されるべきである。

10

【0016】

本明細書において用いられるところ、「C₃₋₆アルケニル」という用語は、炭素および水素原子のみからなり、(E)配置または(Z)配置のいずれかのものであることが可能である少なくとも1つの二重結合を含有し、3~6個の炭素原子を有し、単結合によって分子の残部に結合された直鎖または分岐炭化水素鎖ラジカル基を指す。C₃₋₆アルケニルの例としては、これらに限定されないが、プロプ-1-エニル、アリル(プロプ-2-エニル)、ブタ-1-エニルが挙げられる。

【0017】

本明細書において用いられるところ、「C₃₋₆ハロアルケニル」という用語は、一般に上記に定義されているとおり、1個以上の同一または異なるハロゲン原子によって置換されているC₃₋₆アルケニルラジカルを指す。C₃₋₆ハロアルケニルの例としては、これらに限定されないが、クロロエチレン、フルオロエチレン、1, 1-ジフルオロエチレン、1, 1-ジクロロエチレン、1, 1, 2-トリクロロエチレンが挙げられる。

20

【0018】

本明細書において用いられるところ、「C₃₋₆アルキニル」という用語は、炭素および水素原子のみからなり、少なくとも1つの三重結合を含み、3~6個の炭素原子を有し、単結合によって分子の残部に結合された直鎖または分岐炭化水素鎖ラジカル基を指す。C₃₋₆アルキニルの例としては、これらに限定されないが、プロプ-1-イニル、プロパルギル(プロプ-2-イニル)、ブタ-1-イニルが挙げられる。

【0019】

本明細書において用いられるところ、「C₁₋₄ハロアルコキシ」という用語は、上記に定義されているとおり、1個以上の同一または異なるハロゲン原子によって置換されているC₁₋₄アルコキシ基を指す。C₁₋₂ハロアルコキシ(C₁₋₂フルオロアルコキシを含む)は、相応に解釈されるべきである。C₁₋₄ハロアルコキシの例としては、これらに限定されないが、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、フルオロエトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロエトキシが挙げられる。

30

【0020】

本明細書において用いられるところ、「C₁₋₄アルコキシC₁₋₆アルキル」という用語は、式R_b-O-R_a-のラジカルを指し、ここで、R_bは一般に上記に定義されているC₁₋₄アルキルラジカルであり、および、R_aは一般に上記に定義されているC₁₋₆アルキレンラジカルである。

40

【0021】

本明細書において用いられるところ、「C₁₋₄アルコキシC₁₋₆アルコキシ」という用語は、式R_b-O-R_a-のラジカルを指し、ここで、R_bは一般に上記に定義されているC₁₋₄アルキルラジカルであり、および、R_aは一般に上記に定義されているC₁₋₆アルコキシラジカルである。

【0022】

本明細書において用いられるところ、「C₁₋₂ハロアルコキシC₁₋₆アルキル」という用語は、式R_b-O-R_a-のラジカルを指し、ここで、R_bは一般に上記に定義されているC₁₋₂ハロアルキルラジカルであり、および、R_aは一般に上記に定義されているC₁₋₆ア

50

ルキレンラジカルである。

【0023】

本明細書において用いられるところ、「ヒドロキシ C_{1-6} アルキル」という用語は、一般に上記に定義されているとおり、1個以上の水酸基で置換されている C_{1-6} アルキルラジカルを指す。

【0024】

本明細書において用いられるところ、「シアノ C_{1-6} アルキル」という用語は、一般に上記に定義されているとおり、1個以上のシアノ基で置換されている C_{1-6} アルキルラジカルを指す。

【0025】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-4} アルキルカルボニル」という用語は、式 - C(O)R_aのラジカルを指し、ここで、R_aは、一般に上記に定義されている C_{1-4} アルキルラジカルである。

【0026】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-4} アルコキシカルボニル」という用語は、式 - C(O)OR_aのラジカルを指し、ここで、R_aは、一般に上記に定義されている C_{1-4} アルキルラジカルである。

【0027】

本明細書において用いられるところ、「アミノカルボニル」という用語は、式 - C(O)NH₂のラジカルを指す。

【0028】

本明細書において用いられるところ、「 C_{1-4} アルキルアミノカルボニル」という用語は、式 - C(O)NHR_aのラジカルを指し、ここで、R_aは、一般に上記に定義されている C_{1-4} アルキルラジカルである。

【0029】

本明細書において用いられるところ、「ジ C_{1-4} アルキルアミノカルボニル」という用語は、式 - C(O)NR_a(R_a)のラジカルを指し、ここで、R_aの各々は、一般に上記に定義されている C_{1-4} アルキルラジカルである。

【0030】

本明細書において用いられるところ、「 C_{3-8} シクロアルキル」という用語は、飽和または部分飽和であると共に3～8個の炭素原子を含有する安定な単環式環ラジカルを指す。 C_{3-6} シクロアルキルは相応に解釈されるべきである。 C_{3-8} シクロアルキルの例としては、これらに限定されないが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルが挙げられる。

【0031】

本明細書において用いられるところ、「ヘテロアリアル」という用語は、窒素、酸素および硫黄から独立して選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含む、5員もしくは6員単環式芳香族環または7員～11員芳香族縮合環ラジカルを指す。ヘテロアリアルラジカルは、炭素原子またはヘテロ原子を介して分子の残部に結合され得る。ヘテロアリアルの例としては、フリル、ピロリル、チエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ピラジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピリジニルまたはインドリルが挙げられる。

【0032】

本明細書において用いられるところ、「ヘテロシクリル」または「複素環式」という用語は、窒素、酸素および硫黄から独立して選択される1、2または3個のヘテロ原子を含む、安定な4員～6員非芳香族単環式環または7員～11員非芳香族縮合環ラジカルを指す。ヘテロシクリルラジカルは、炭素原子またはヘテロ原子を介して分子の残部に結合され得る。ヘテロシクリルの例としては、これらに限定されないが、ピロリニル、ピロリジニル、テトラヒドロフリル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペリジニル、ピペラジニル、テトラヒドロピラニル、ジヒドロイソキサゾリル、ジオキサニル、

10

20

30

40

50

モルホリニル、 β -ラクタミル、ペルヒドロアゼピニル、インドリニルまたはベンズイミダゾールが挙げられる。

【0033】

式(I)の化合物中に1個以上の不斉炭素原子の存在が可能であるとは、その化合物がキラル異性形態、すなわち、鏡像異性形態またはジアステレオ異性形態をとり得ることを意味する。また、単結合に係る回転の制限によってアストロブ異性体が生じ得る。式(I)は、すべてのこれらの可能性のある異性形態およびその混合物を含むことが意図されている。本発明は、式(I)の化合物に係るすべてのこれらの可能性のある異性形態およびその混合物を含む。同様に、式(I)は、存在する場合、すべての可能性のある互変異性体(ラクタム-ラクチム互変異性およびケト-エノール互変異性を含む)を含むことが意図されている。本発明は、式(I)の化合物に係るすべての可能性のある互変異性形態を含む。

10

【0034】

各事例において、本発明に係る式(I)の化合物は、遊離形態、N-オキシドとしての酸化型、共有結合的に水和した形態、または、例えば農業経済学的に使用可能なまたは農芸化学的に許容可能な塩形態といった塩形態である。

【0035】

N-オキシドは、第三級アミンの酸化型、または、窒素含有芳香族複素環式化合物の酸化型である。これらは、例えば、書籍“Heterocyclic N-oxides”, A. Albini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991に記載されている。

20

【0036】

以下のリストは、本発明に係る式(I)の化合物に関する置換基 n 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、および L^1 についての、好ましい定義を含む定義を提供する。これらの置換基のいずれか1つについて、以下に示される定義のいずれかが、以下または本明細書の他の箇所に示されるいずれかの他の置換基のいずれかの定義と組み合わせられ得る。

【0037】

n は1または2である。本発明のいくつかの実施形態において、 n は1である。本発明の他の実施形態において、 n は2である。

30

【0038】

A^1 はNまたは CR^1 を表し、ここで、 R^1 は、水素、ハロゲン、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシまたはジフルオロメトキシである。好ましくは、 A^1 はNまたは CR^1 を表し、ここで、 R^1 は、水素、ハロゲンまたはメチルから選択される。より好ましくは、 R^1 は、水素、クロロ、フルオロまたはメチルである。さらにより好ましくは、 R^1 は水素、フルオロまたはメチルであり、最も好ましくは、 R^1 は水素である。

【0039】

A^2 はNまたは CR^2 を表し、ここで、 R^2 は、水素、ハロゲン、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシまたはジフルオロメトキシを表す。好ましくは、 A^2 はNまたは CR^2 を表し、ここで、 R^2 は、水素、ハロゲンまたはメチルから選択される。より好ましくは、 R^2 は、水素、フルオロまたはメチルである。さらにより好ましくは、 R^2 は水素またはフルオロであり、最も好ましくは、 R^2 は水素である。

40

【0040】

A^3 はNまたは CR^3 を表し、ここで、 R^3 は、水素またはフルオロを表す。好ましくは、 R^3 は水素である。

【0041】

A^4 はNまたは CR^4 を表し、ここで、 R^4 は、水素またはフルオロを表す。好ましくは、 R^4 は水素である。

50

【0042】

本発明のさらなる実施形態において、 R^3 および R^4 は水素である。

【0043】

本発明の一実施形態において、 A^1 は CR^1 を表し、 A^2 は CR^2 を表し、および、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 の0、1または2つはフッ素であり、ここで、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 のいずれもがフッ素ではない場合、これは水素である。

【0044】

本発明の一実施形態において、 A^2 および A^4 はC-Hであり、ならびに、 A^1 および A^3 はC-Fである。本発明の他の実施形態において、 A^1 、 A^2 および A^4 はC-Hであり、ならびに、 A^3 はC-Fである。本発明の他の実施形態において、 A^1 、 A^2 、 A^3 および A^4 はC-Hである。

10

【0045】

R^5 および R^6 は、水素、ハロゲン、シアノ、メチル、エチル、メトキシもしくは C_{1-2} ハロアルキルから独立して選択され；または、 R^5 および R^6 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 C_{3-6} シクロアルキル環（例えば、シクロプロピル）を形成する。好ましくは、 R^5 および R^6 は、水素、メチル、メトキシまたは C_{1-2} ハロアルキルから独立して選択される。より好ましくは、 R^5 および R^6 は、水素またはメチルから独立して選択される。さらにより好ましくは、 R^5 および R^6 は共に水素である。

【0046】

L^1 は、 $-O-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-(R^8)NC(O)O-$ または $-(R^{10})C=N-O-$ を表す。本発明のいくつかの実施形態において、 L^1 は $-O-$ である。本発明の他の実施形態において、 L^1 は $-C(O)O-$ である。本発明の他の実施形態において、 L^1 は $-(R^8)NC(O)O-$ である。本発明の他の実施形態において、 L^1 は $-(R^{10})C=N-O-$ である。

20

【0047】

好ましくは、 L^1 は $-O-$ または $-C(O)O-$ であり、より好ましくは、 L^1 は $-O-$ である。

【0048】

R^7 は、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-6} アルキニル、シアノ C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{3-6} ハロアルケニル、ヒドロキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-2} ハロアルコキシ C_{1-6} アルキルもしくは $-CH=N-O-C_{1-4}$ アルキルを表し；または、 R^7 は、 C_{3-8} シクロアルキル（ここで、シクロアルキル部分は任意選択により部分飽和である）、フェニル、炭素原子を介して L^1 に結合したヘテロアリール（ここで、ヘテロアリール部分は、N、OおよびSから独立して選択される1、2、3もしくは4個のヘテロ原子を含む5員もしくは6員単環式芳香族環である）、炭素原子を介して L^1 に結合したヘテロシクリル（ここで、ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択される1、2もしくは3個のヘテロ原子を含む4員～6員非芳香族環である）を表し、ならびに、 C_{3-8} シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルは、 R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基で任意選択により置換されており；

30

40

ここで、 R^7 が C_{3-8} シクロアルキルまたはヘテロシクリルを表す場合、 C_{3-8} シクロアルキル部分またはヘテロシクリル部分は、1もしくは2個のオキソ基で任意選択により置換されている。

【0049】

好ましくは、 R^7 は、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルを表し、ここで、フェニル、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルは、 R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基で任意選択により置換されている。より好ましくは、 R^7 は C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルを表し、ここで、ヘテロシクリル部分は、N、OおよびSから独立して選択

50

される1、2もしくは3個のヘテロ原子を含む5員非芳香族環であり、ここで、フェニル、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルは、 R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基で任意選択により置換されている。さらにより好ましくは、 R^7 はメチル、エチル、イソプロピル、*t*-ブチル、2,2,2-トリフルオロエチル、シクロプロピル、フェニル、ピリジニル、ピリダジニル、イソオキサゾリル、ジヒドロイソキサゾリル、テトラゾリル、ピラゾリル、オキサジアゾリルまたはモルホリニルを表し、ここで、各フェニル、ピリジニル、ピリダジニル、イソオキサゾリル、ジヒドロイソキサゾリル、テトラゾリル、ピラゾリルおよびオキサジアゾリルは、 R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基で任意選択により置換されている。

10

【0050】

本発明のいくつかの実施形態において、 R^7 は、メチル、フルオロまたはシアノから独立して選択される1もしくは2個の R^9 によって任意選択により置換され得るフェニルを表す。他の実施形態において、 R^7 はピリジニルを表し、これは、メチル、フルオロ、シアノまたはトリフルオロメチルから選択される単一の R^9 で任意選択により置換されていてもよい。さらなる実施形態において、 R^7 は、イソオキサゾリル、ジヒドロイソキサゾリルまたはテトラゾリルを表し、これは、1もしくは2個の R^9 で任意選択により置換されていてもよく、ここで、各 R^9 はメチルである。

【0051】

R^7 が C_{3-6} シクロアルキルまたはヘテロシクリルを表す場合、 C_{3-6} シクロアルキル部分またはヘテロシクリル部分は、任意選択により、1もしくは2個のオキソ基で置換されていてもよい。

20

【0052】

R^7 を表す特に好ましい基は、メチル、イソプロピル、*t*-ブチル、シクロプロピル、フェニル、2-メチルフェニル、2-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2,6-ジフルオロフェニル、4-シアノフェニル、2-ピリジル、5-メチル-2-ピリジル、5-フルオロ-2-ピリジル、5-トリフルオロメチル-2-ピリジル、6-シアノ-2-ピリジル、4-シアノ-2-ピリジル、イソキサゾール-3-イル、5-メトキシイソキサゾール-3-イル、4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル、4,4-ジメチル-5H-イソキサゾール-3-イルおよび5,5-ジメチル-4H-イソキサゾール-3-イル、1-メチルピラゾール-3-イル、1-メチルテトラゾール-5-イル、5-メチル-1H-ピラゾール-3-イル、1-メチルカルボニルピラゾール-1-イルおよびイミダゾール-1-イルである。

30

【0053】

R^7 を表すさらに特に好ましい基は、メチル、シクロプロピル、2-フルオロフェニル、5-メトキシイソキサゾール-3-イル、4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル、4,4-ジメチル-5H-イソキサゾール-3-イル、5,5-ジメチル-4H-イソキサゾール-3-イル、1-メチルピラゾール-3-イル、1-メチルテトラゾール-5-イル、5-メチル-1H-ピラゾール-3-イル、1-メチルカルボニルピラゾール-1-イルおよびイミダゾール-1-イルである。

40

【0054】

R^8 は、水素、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシまたはメチルカルボニルを表す。好ましくは、 R^8 は、水素、メチル、メトキシまたはメチルカルボニルを表す。

【0055】

R^9 は、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} ハロアルコキシ、 C_{1-4} アルキルカルボニル、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 C_{1-4} アルキルアミノカルボニル、ジ C_{1-4} アルキルアミノカルボニルを表す。好ましくは、 R^9 は、シアノ、ハロゲン、 C_{1-4} アルキルまたは C_{1-4} ハロアルキルを表す。より好ましくは、 R^9 は、シアノ、クロロ、プロモ、フルオロ、ヨード、メチル、イソプロピル、*t*-ブチル、ジフルオロメチルまたはトリフルオロメチルを表す

50

。さらにより好ましくは、 R^9 は、シアノ、フルオロ、メチルおよびトリフルオロメチルを表す。

【0056】

R^{10} は C_{1-4} アルキルである。好ましくは、 R^{10} はメチルである。

【0057】

L^1 が $-C(O)O-$ または $-(R^{10})C=N-O-$ である場合、 R^7 は窒素原子を含むヘテロシクリル環であり得、ここで、ヘテロシクリルは窒素原子を介して L^1 に結合しており、および、ヘテロシクリル部分は、N、OまたはSから選択される追加のヘテロ原子を任意選択により含む4員~6員非芳香族環であり、および、ヘテロシクリルは、 R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基で任意選択により置換されており；または

L^1 が $-(R^{10})C=N-O-$ である場合、 R^7 は窒素原子を含むヘテロアリアル環であり得、ここで、ヘテロアリアルは窒素原子を介して L^1 に結合しており、および、ヘテロアリアル部分は、追加の1もしくは2個の窒素原子を任意選択により含む5員もしくは6員単環式芳香族環であり、および、ヘテロアリアルは、 R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基で任意選択により置換されており；または

L^1 が $-(R^{10})C=N-O-$ である場合、 R^7 および R^{10} は、これらが結合している炭素原子と一緒に、任意選択により部分飽和もしくは完全不飽和であり、および、任意選択により1もしくは2個の窒素原子を含有する4員、5員もしくは6員環を形成し得、ここで、環は、 R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基で任意選択により置換されており、および、任意選択により、 $C(O)$ または $S(O)_2$ から選択される1個の基をさらに含有していてもよい。

【0058】

好ましくは、式(I)に係る化合物は、表T1(以下)に列挙されている化合物1.1~1.27、または、表T2(以下)に列挙されている化合物2.1~2.3、または、表T3(以下)に列挙されている化合物3.1~3.11、または、表T4(以下)に列挙されている化合物4.1~4.4から選択される。

【0059】

好ましくは、本発明の式(I)に係る化合物において、 n は1または2であり；

A^1 はNまたは CR^1 を表し、ここで、 R^1 は、水素、ハロゲンまたはメチルから選択され；

A^2 はNまたは CR^2 を表し、ここで、 R^2 は、水素、ハロゲンまたはメチルから選択され；

A^3 は CR^3 を表し、ここで、 R^3 は水素またはフルオロであり；

A^4 は CR^4 を表し、ここで、 R^4 は水素またはフルオロであり；

R^5 および R^6 は、水素もしくはメチルから独立して選択され；または

L^1 は $-O-$ を表し；

R^7 は C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリアルまたはヘテロシクリルを表し、ここで、 C_{3-8} シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリアルおよびヘテロシクリルは、 R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基で任意選択により置換されており；ならびに

R^9 は、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} アルコキシまたは C_{1-4} ハロアルコキシを表す。

【0060】

より好ましくは、 n は1であり；

A^1 はNまたは CR^1 を表し、ここで、 R^1 は、水素、ハロゲンまたはメチルから選択され；

A^2 はNまたは CR^2 を表し、ここで、 R^2 は、水素、ハロゲンまたはメチルから選択され；

10

20

30

40

50

A^3 は CR^3 を表し、ここで、 R^3 は水素またはフルオロであり；
 A^4 は CR^4 を表し、ここで、 R^4 は水素またはフルオロであり；
 R^5 および R^6 は、水素およびメチルから独立して選択され；または
 L^1 は $-O-$ を表し；
 R^7 は C_{1-6} アルキル、フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルを表し、ここで、フェニル、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルは、 R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基で任意選択により置換されており；
 R^9 は、シアノ、ハロゲン、 C_{1-4} アルキルおよび C_{1-4} ハロアルキルを表す。

【0061】

さらにより好ましくは、 n は1であり；
 A^1 は CR^1 を表し、ここで、 R^1 は水素であり；
 A^2 は CR^2 を表し、ここで、 R^2 は水素であり；
 A^3 は CR^3 を表し、ここで、 R^3 は水素であり；
 A^4 は CR^4 を表し、ここで、 R^4 は水素であり；
 R^5 および R^6 は共に水素を表し；
 L^1 は $-O-$ を表し；
 R^7 は、 C_{1-6} アルキル、フェニル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルを表し、ここで、フェニル、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルは、 R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1、2もしくは3個の置換基で任意選択により置換されており；
 ならびに
 R^9 は、シアノ、ハロゲン、 C_{1-4} アルキルおよび C_{1-4} ハロアルキルを表す。

10

20

【0062】

好ましくは、本発明の式(I)に係る化合物において、 n は1であり；
 A^1 は CR^1 を表し、ここで、 R^1 は水素であり；
 A^2 は CR^2 を表し、ここで、 R^2 は水素であり；
 A^3 は CR^3 を表し、ここで、 R^3 は水素であり；
 A^4 は CR^4 を表し、ここで、 R^4 は水素であり；
 R^5 および R^6 は、水素およびメチルから独立して選択され；または
 L^1 は $-C(O)O-$ を表し；ならびに
 R^7 は、 C_{1-6} アルキル、シアノ C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキルまたはヒドロキシ C_{1-6} アルキルを表す。

30

【0063】

好ましくは、本発明の式(I)に係る化合物において、 n は1であり；
 A^1 は CR^1 を表し、ここで、 R^1 は水素であり；
 A^2 は CR^2 を表し、ここで、 R^2 は水素であり；
 A^3 は CR^3 を表し、ここで、 R^3 は水素であり；
 A^4 は CR^4 を表し、ここで、 R^4 は水素であり；
 R^5 および R^6 は共に水素を表し；
 L^1 は $-(R^{10})C=N-O-$ を表し；
 R^7 は C_{1-6} アルキルを表し；
 R^{10} は C_{1-6} アルキル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルを表し；または
 R^7 および R^{10} は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、任意選択により部分飽和もしくは完全不飽和であり、および、任意選択により1もしくは2個の窒素原子を含有する6員環を形成し得、ここで、環は、 R^9 から選択される同一であっても異なってもよい1または2個の置換基で任意選択により置換されており、および、任意選択により、1個の $C(O)$ 基を含有し得；ならびに、 R^9 は、シアノ、ハロゲン、 C_{1-4} アルキルおよび C_{1-4} ハロアルキルを表す。

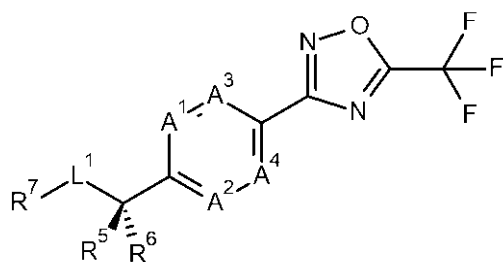
40

【0064】

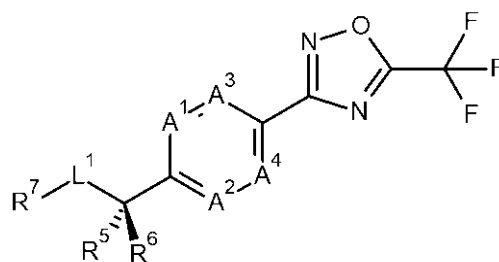
本発明の化合物は、 R^5 および R^6 が異なる式(Ia)または式(Ib)によって表される式(I)の化合物の鏡像異性体であり得る。

50

【化2】



(la)



(lb)

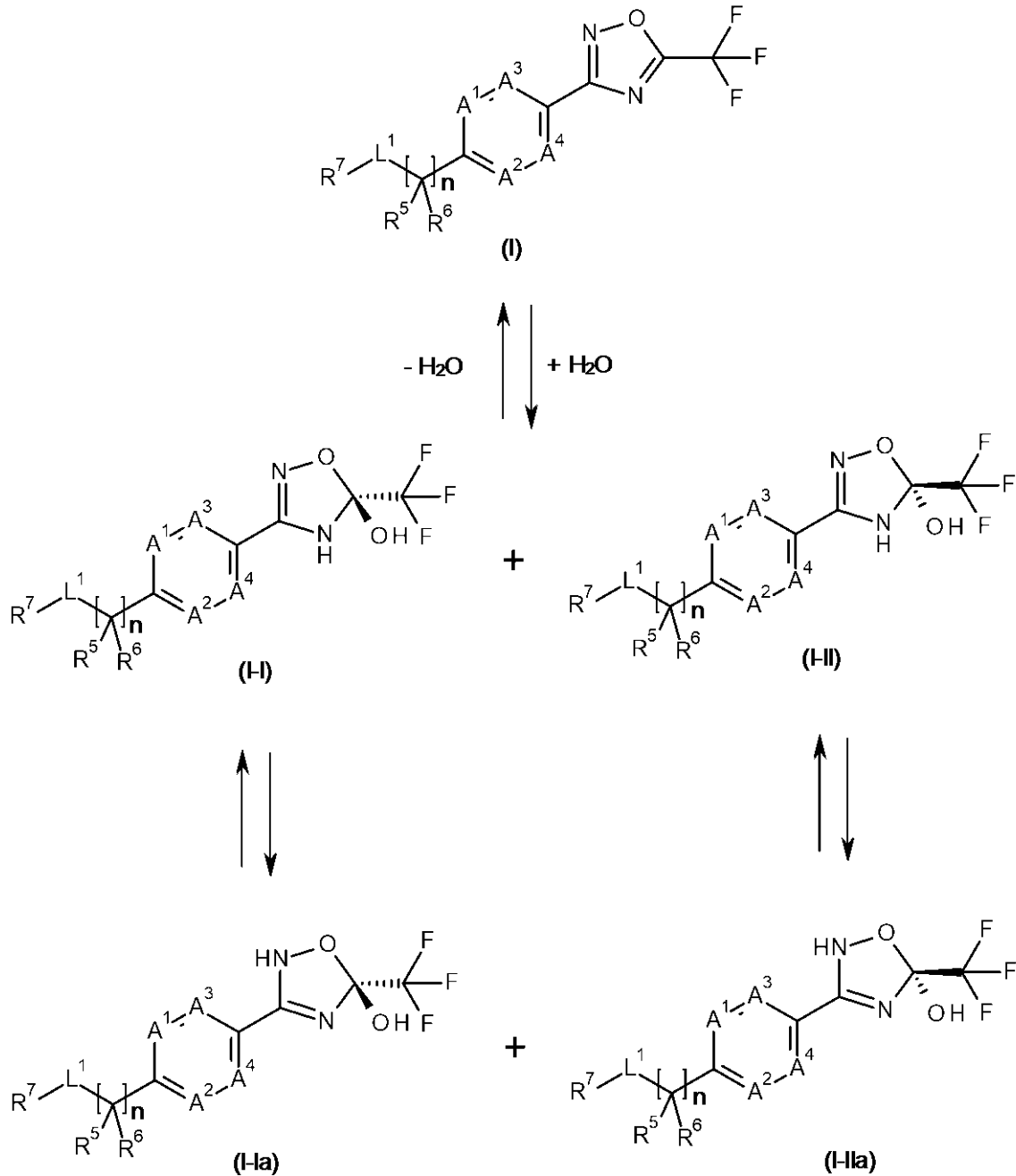
10

【0065】

水性媒体中にある場合、本発明に係る式(I)の化合物は、CF₃-オキサジアゾールモチーフにおいて、対応する共有結合的に水和した形態(すなわち、以下に示されている式(I-I)および式(I-II)の化合物であって、これらは、式(I-Ia)および式(I-IIa)の化合物として互変異性形態で存在し得る)と可逆平衡状態で存在し得ることが理解される。この動的平衡は式(I)の化合物の生物学的活性に重要であり得る。本発明の式(I)の化合物に関するn、A¹、A²、A³、A⁴、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰およびL¹の表示は、一般に、式(I-I)、(I-II)、(I-Ia)および(I-IIa)の化合物に適用され、表1.1~1.12または表T1(以下)に記載の化合物1.1~1.27;表2.1~2.4または表T2(以下)に記載の化合物2.1~2.3;表3.1~3.6または表T3(以下)に記載の化合物3.1~3.11;または、表T4(以下)に記載の化合物4.1~4.4に表記されている、n、A¹、A²、A³、A⁴、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰およびL¹の組み合わせの特定の開示についても同様である。

20

【化3】



10

20

30

【0066】

本発明の化合物は、以下のスキーム1～13に示されるように形成されることが可能であり、ここで、特に記載しない限り、各可変要素の定義は、式(I)の化合物について上記に定義されるとおりである。

40

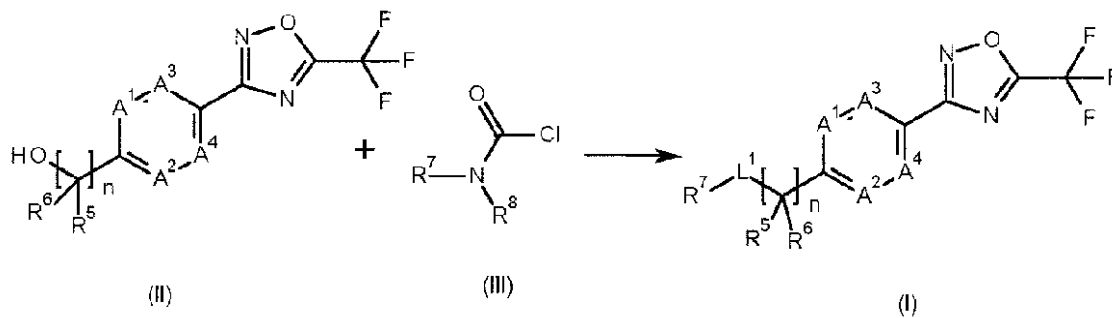
【0067】

式(I)の化合物(式中、L¹は-N(R⁸)C(O)O-であり、および、nは1または2である)は、式(II)の化合物および式(III)の化合物を伴うエステルカップリング変換により、好ましくは、好適な溶剤(例えば、ジメチルホルムアミド、ジクロロメタンまたはテトラヒドロフラン)中において、好ましくは、25～100の温度で、および、任意選択によりトリエチルアミンまたはピリジンなどの塩基の存在下で得ることが可能である。式(III)の化合物は、市販されているか、または、公知の方法を用いて調製される。関連する例に関しては: Hoppe, D., Bronneke, A. Synthesis (1982), 1045; および、Yamagami, C. et al Chem. & Pharm. Bull., (1982), 30, 4175を参照のこと

50

。この反応はスキーム 1 に示されている。

【化 4】



スキーム 1

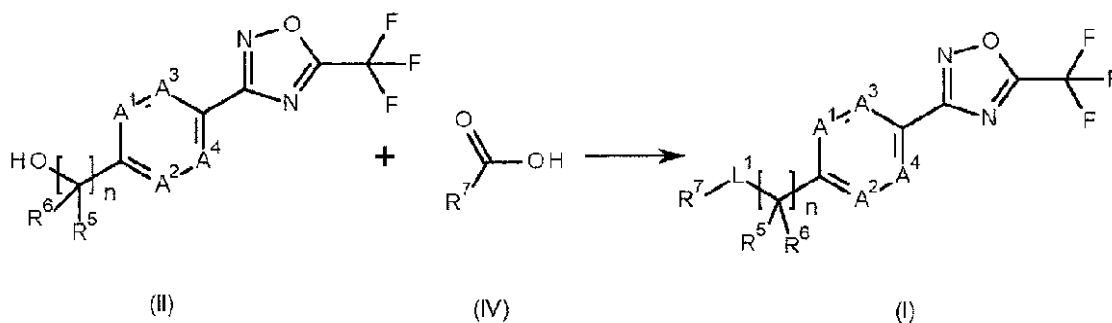
10

【0068】

式 (I) の化合物 (式中、 L^1 は $-C(O)O-$ であり、および、 n は 1 または 2 である) は、式 (IV) の化合物のカルボン酸官能基を活性化することによる式 (II) の化合物および式 (IV) の化合物を伴うエステルカップリング変換によって得ることが可能であり、このプロセスは、通常は、例えば $(COCl)_2$ または $SOCl_2$ を用いることでカルボン酸の $-OH$ を塩化物基などの良好な脱離基に転換し、その後、好ましくは好適な溶剤 (例えば、ジメチルホルムアミド、ジクロロメタンまたはテトラヒドロフラン) 中、好ましくは、 $25 \sim 100$ の温度、および、任意選択により、トリエチルアミンもしくは N, N -ジイソプロピルエチルアミンなどの塩基の存在下、または、エステルカップリングに関して文献中において記載されている条件下で式 (II) の化合物を処理することにより行われる。関連する例に関しては：国際公開第 2013/066835 号および Dao, H. T. et al J. Am. Chem. Soc. (2015), 137, 8046 を参照のこと。式 (IV) の化合物は市販されているか、または、公知の方法を用いて調製される。この反応はスキーム 2 に示されている。

20

【化 5】



スキーム 2

30

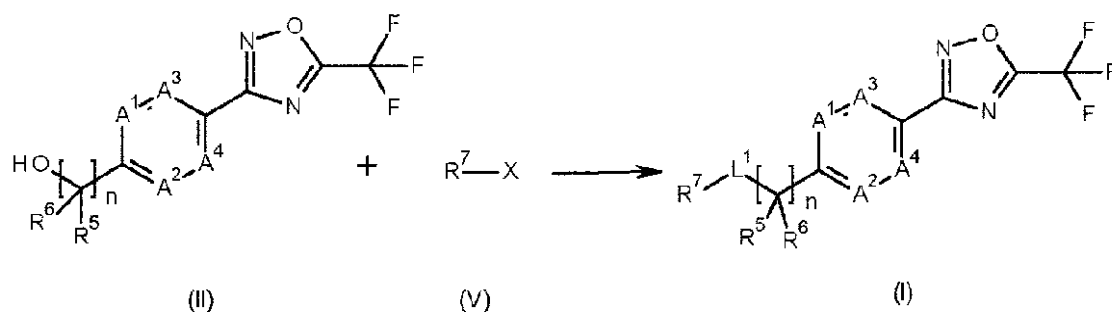
40

【0069】

あるいは、式 (I) の化合物 (式中、 L^1 は $-O-$ であり、および、 n は 1 または 2 である) は、式 (V) の化合物 (式中、 X は、 Cl 、 Br または I である) から、 NaH などの好適な塩基の存在下における、ジメチルホルムアミドまたはテトラヒドロフランなどの好適な溶剤中、 $0 \sim 100$ の温度での式 (II) のアルコールによる処理を介して調製可能である。場合によっては、良好な反応性能が、触媒 (例えば、 NaI または 4-ジメチルアミノピリジン) の使用およびマイクロ波照射により達成され得る。関連する例に関しては、国際公開第 2011/0021482 号を参照のこと。式 (V) の化合物は市販されている。この反応はスキーム 3 に示されている。

50

【化6】



10

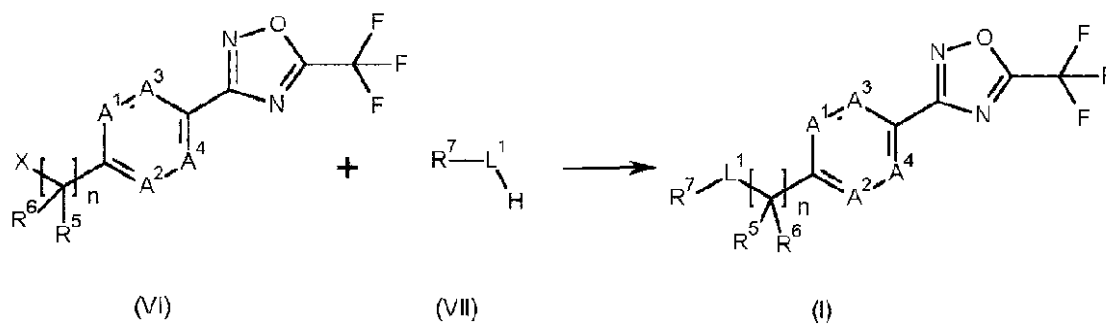
スキーム3

【0070】

また、式 (I) の化合物 (式中、 L^1 は $-O-$ 、 $-C(O)O-$ または $-(R^{10})C=N-O-$ であり、および、 n は好ましくは 1 である) は、式 (VI) の化合物 (式中、 X は、ハロゲン、好ましくは、 Cl 、 Br 、 I または $-OSO_2OMe$ である) から、塩基 (例えば K_2CO_3 、 Cs_2CO_3 、 $KOAc$ または NaH) の存在下における、好適な溶剤 (例えばジメチルホルムアミドまたはテトラヒドロフラン) 中、 $25 \sim 110$ の温度での式 (VII) の化合物による処理を介して調製可能である。場合によっては、良好な反応性能が、触媒 (例えば、 NaI または 4-ジメチルアミノピリジン) の使用およびマイクロ波照射により達成され得る。関連する例に関しては: Patrick, D. A. et al. Eur. J. Med. Chem. (2013) 67, 310 または国際公開第 2008/136324 号を参照のこと。式 (VII) の化合物は市販されている。この反応はスキーム 4 に示されている。

20

【化7】



30

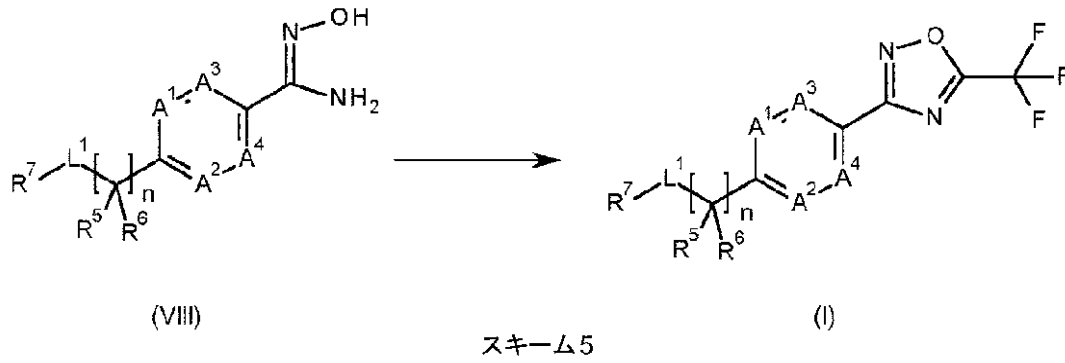
スキーム4

【0071】

さらに、式 (I) の化合物は、塩基 (例えば、ピリジンまたは 4-ジメチルアミノピリジン) の存在下における、テトラヒドロフランまたはエタノールなどの好適な溶剤中、 $25 \sim 75$ の温度でのトリフルオロ酢酸無水物による処理によって、式 (VIII) の化合物から調製可能である。関連する例に関しては、国際公開第 2003/028729 号および国際公開第 2010/045251 号を参照のこと。この反応はスキーム 5 に示されている。

40

【化8】

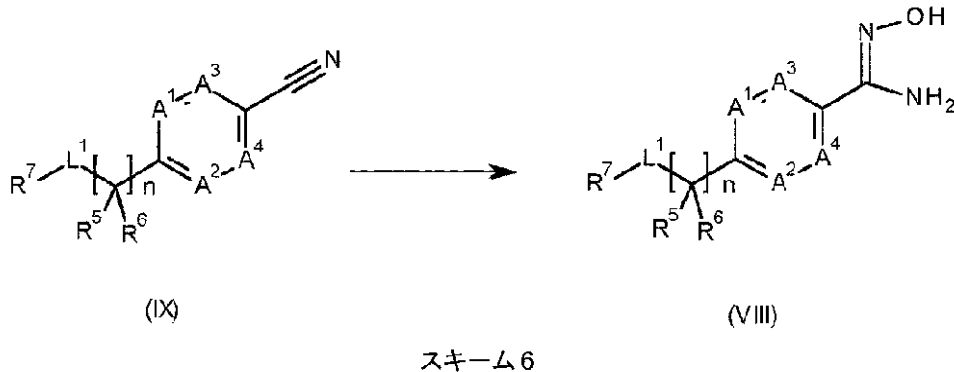


10

【0072】

式(VIII)の化合物は、トリエチルアミンなどの塩基の存在下における、メタノールなどの好適な溶剤中、0 ~ 100 の温度での塩酸ヒドロキシルアミン塩による処理によって、式(IX)の化合物から調製可能である。関連する例に関しては、Kitamura, S. et al Chem. Pharm. Bull. (2001), 49, 268および国際公開第2013/066838号を参照のこと。この反応はスキーム6に示されている。

【化9】



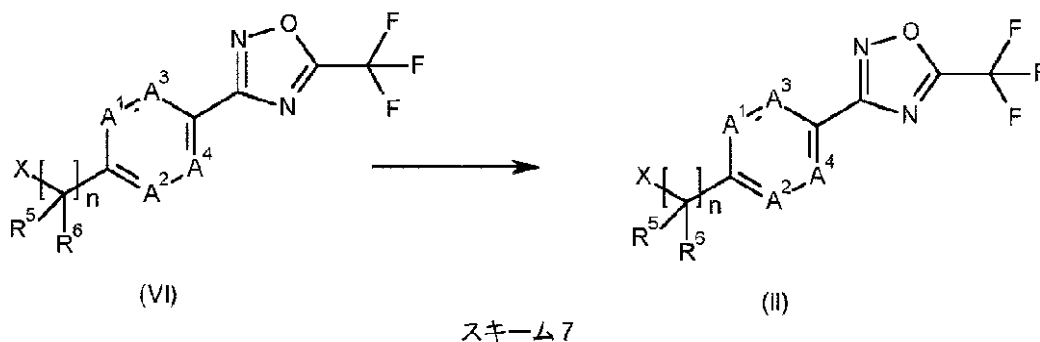
20

30

【0073】

式(II)の化合物は、式(VI)の化合物(式中、Xは-OC(O)CF₃または-OC(O)CH₃である)から、メタノールなどの好適な溶剤中における、25 でのNa₂CO₃またはK₂CO₃などの好適な塩基を用いるエステルの鹸化を介して調製可能である。関連する例に関しては：Kawate, T. et al Bioorg. & Med. Chem. Lett., (2013), 23, 6052を参照のこと。この反応はスキーム7に示されている。

【化10】



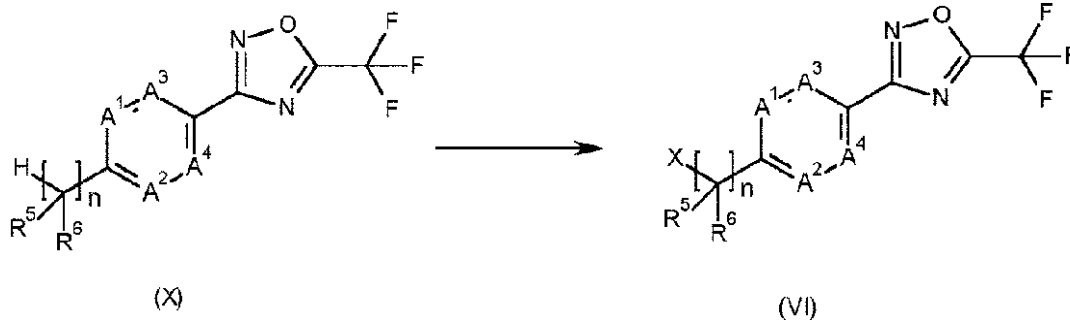
40

【0074】

50

式(VI)の化合物(式中、XはClまたはBrであり、および、nは1である)は、テトラクロロメタンなどの好適な溶剤中における、55 ~ 100 の温度、紫外光の存在下でのハロゲン供給源(例えば、N-ブロモスクシンイミド(NBS)またはN-クロロスクシンイミド(NCS))およびラジカル開始剤(例えば、(PhCO₂)₂またはアゾビスイソブチロニトリル(AIBN))による処理によって、式(X)の化合物から調製可能である。関連する例に関しては、Liu, S. et al Synthesis (2001), 14, 2078およびKompella, A. et al Org. Proc. Res. Dev. (2012), 16, 1794を参照のこと。この反応はスキーム8に示されている。

【化11】

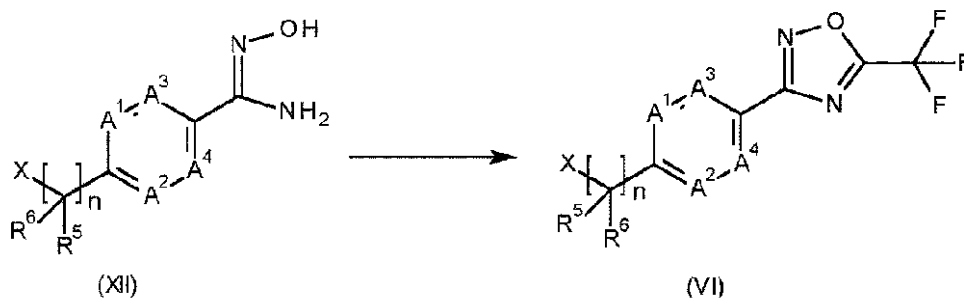


スキーム8

【0075】

あるいは、式(VI)の化合物(式中、Xはハロゲン、-OC(O)CH₃、-OC(O)CF₃である)は、塩基(例えば、ピリジンまたは4-ジメチルアミノピリジン)の存在下における、テトラヒドロフランまたはエタノールなどの好適な溶剤中、25 ~ 75 の温度でのトリフルオロ酢酸無水物による処理によって、式(XII)の化合物(式中、Xは、ハロゲン、-OH、-OC(O)CF₃である)から調製可能である。関連する例に関しては、国際公開第2003/028729号および国際公開第2010/045251号を参照のこと。この反応はスキーム9に示されている。

【化12】



スキーム9

【0076】

式(XII)の化合物は、トリエチルアミンなどの塩基の存在下における、メタノールなどの好適な溶剤中、0 ~ 100 の温度での塩酸ヒドロキシルアミン塩による処理によって、式(XIII)の化合物から調製可能である。関連する例に関しては、Kitamura, S. et al Chem. Pharm. Bull. (2001), 49, 268および国際公開第2013/066838号を参照のこと。この反応はスキーム10に示されている。

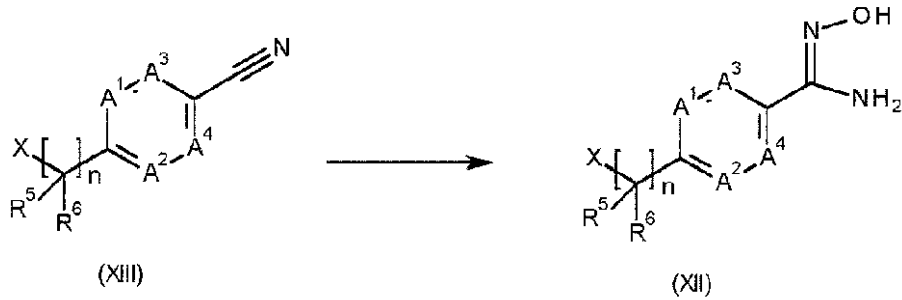
10

20

30

40

【化13】



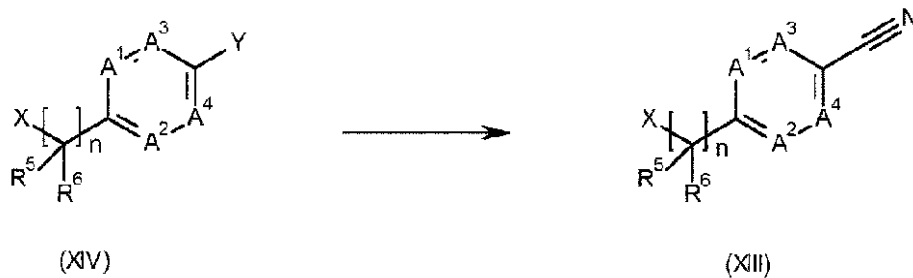
スキーム10

10

【0077】

式(XIII)の化合物は、好適な溶剤(例えば、ジメチルホルムアミドまたはN-メチルピロリドン)中における、100 ~ 120 の高温でのPd(0)/Zn(CN)₂またはCuCNなどの好適なシアン化物試薬を伴う金属促進反応を介して式(XIV)の化合物(式中、YはBrまたはIである)から調製可能である。関連する例に関しては、米国特許出願公開第2007/0155739号明細書および国際公開第2009/022746号を参照のこと。この反応はスキーム11に示されている。

【化14】



スキーム11

20

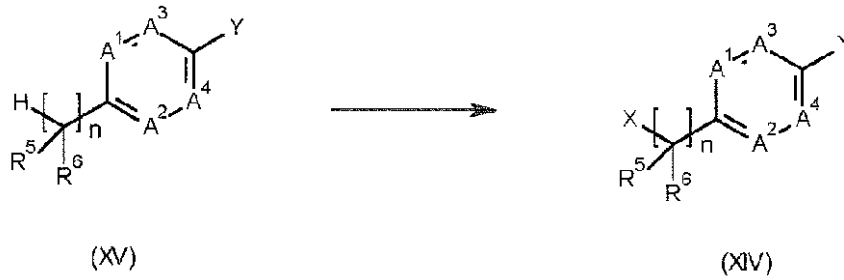
【0078】

式(XIV)の化合物(式中、Yは、Br、IまたはCNであり、および、Xは、Cl、BrまたはIであり、および、nは1である)は、市販されているか、または、紫外光の存在下における、テトラクロロメタンなどの好適な溶剤中、55 ~ 100 の温度での、ハロゲン供給源(例えばN-ブロモスクシンイミド(NBS)またはN-クロロスクシンイミド(NCS))、および、(PhCO₂)₂またはアゾビスイソブチロニトリル(AIBN)などのラジカル開始剤による処理によって、式(XV)の化合物から調製可能である。関連する例に関しては、Liu, S. et al. *Synthesis* (2001), 14, 2078およびKompella, A. et al. *Org. Proc. Res. Dev.* (2012), 16, 1794を参照のこと。式(XV)の化合物は市販されている。この反応はスキーム12に示されている。

30

40

【化15】



スキーム12

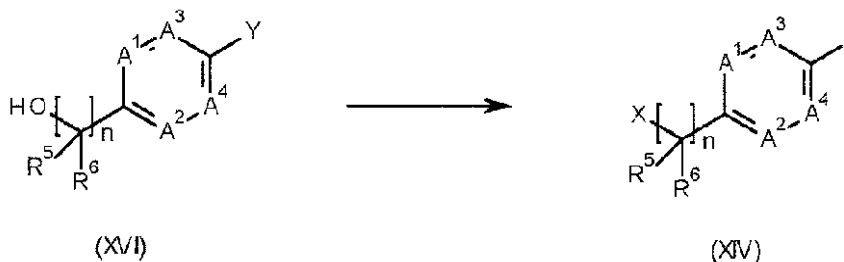
10

【0079】

あるいは、式(XIV)の化合物(式中、Xは、Cl、Br、I、-OSO₂CH₃または-OC(O)CH₃であり、および、Yは、Br、IまたはCNである)は、市販されているか、または、トリフェニルホスフィンの存在下におけるハロゲン供給源(例えば、CCl₃Br、CCl₄またはI₂)による処理によって、もしくは、メタンスルホニルクロリド(ClSO₂Me)による処理によって、もしくは、CH₃C(O)Clによる処理によって、好適な溶剤(例えば、ジクロロメタン)中において、0~100の温度で、式(XVI)の化合物から調製可能である。関連する例に関しては、Liu, H. et al. *Bioorg. & Med. Chem.* (2008), 16, 10013、国際公開第2014/020350号およびKompella, A. et al. *Bioorg. & Med. Chem. Lett.* (2001), 1, 3161を参照のこと。式(XVI)の化合物は市販されている。この反応はスキーム13に示されている。

20

【化16】



スキーム13

30

【0080】

既に示されるように、意外なことに、本発明に係る式(I)の新規な化合物が、実際上、真菌によって引き起こされる病害に対する植物の保護に係る非常に有利なレベルの生物学的活性を有することがここで見出された。

【0081】

式(I)の化合物は、農業部門および関連する使用分野において、例えば、植物有害生物または非生体材料の防除、ヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物もしくは生物の防除に係る活性成分として用いられることが可能である。新規化合物は、低施用量での優れた活性、植物による優れた耐容性、および、環境に対して安全であることにより際だって優れたものである。これらはきわめて有用な治療的特性、予防的特性および浸透移行特性を有すると共に、数多くの栽培植物の保護に用いられ得る。式(I)の化合物は、有用な植物の異なる作物の植物または植物の一部(果実、花、葉、茎、塊茎、根)に生じる有害生物を阻害または駆除するために、他方では、同時に、後に成長する植物のこれらの部位をも例えば植物病原性微生物から保護するために用いられることが可能である。

40

【0082】

本発明はさらに、植物または植物繁殖体および/または収穫された食品作物を処理することによって、微生物被害を受けやすい植物または植物繁殖体および/または収穫された

50

食品作物の外寄生を防除または予防するための方法であって、有効量の式(I)の化合物が、植物、その一部またはその生息地に適用される方法に関する。

【0083】

式(I)の化合物を殺菌剤(殺真菌剤)(fungicide)として用いることも可能である。「殺菌」という用語は、本明細書において用いられるところ、真菌の増殖を防除し、変性させ、または、防止する化合物を意味する。「殺菌的に有効な量」という用語は、用いられるところ、真菌の増殖に効果をもたらすことが可能である、このような化合物またはこのような化合物の組み合わせの量を意味する。防除または変性効果は、死滅、遅滞等などの自然の発育からの逸脱のすべてを含み、予防は、真菌による感染を予防するための植物におけるバリアまたは他の防御形成を含む。

10

【0084】

土壤中で発生する真菌性感染症、ならびに、植物病原性真菌に対する保護のために、例えば果実、塊茎もしくは穀粒などの種子または植物挿穂といった植物繁殖体を処理する粉衣剤として式(I)の化合物を用いることも可能であり得る。この繁殖体は、植え付け前に式(I)の化合物を含む組成物で処理することが可能である：例えば、種子は、播種される前に粉衣されることが可能である。式(I)の活性化合物はまた、種子を液体配合物中に含浸させるか、または、種子を固体配合物でコーティングすることにより穀粒に適用(コーティング)することが可能である。組成物はまた、繁殖体が植え付けられる際に植え付け箇所に適用が可能であり、例えば、播種の最中において蒔き溝に適用が可能である。本発明はまた、このような植物繁殖体の処理方法、および、このようにして処理された植物繁殖体にも関する。

20

【0085】

さらに、式(I)化合物は、例えば、木材および木材系工業用製品を含む工業用材料の保護、食品保管、衛生管理といった関連する分野における真菌の防除に用いられることが可能である。

【0086】

加えて、本発明は、例えば材木、壁板および塗料といった非生体材料を真菌による作用から保護するために用いられることが可能である。

【0087】

式(I)の化合物は、例えば、病害に係る真菌および真菌媒介物、ならびに、植物病原性バクテリアおよびウイルスに対して効果的である。これらの病害に係る真菌および真菌媒介物、ならびに、植物病原性バクテリアおよびウイルスは、例えば以下のとおりである。

30

アブシジアコリムピフェラ(*Absidia corymbifera*)、アルテルナリア属の一種(*Alternaria spp.*)、アフアノミセス属の一種(*Aphanomyces spp.*)、アスコキタ属の一種(*Ascochyta spp.*)、A.フラバス(*A. flavus*)、A.フミガーツス(*A. fumigatus*)、A.ニズランス(*A. nidulans*)、A.ニガー(*A. niger*)、A.テルス(*A. terrus*)を含むアスペルギルス属の一種(*Aspergillus spp.*)、A.プルランス(*A. pullulans*)を含むアウレオバシジウム属の一種(*Aureobasidium spp.*)、ブラストミセスデルマチチディス(*Blastomyces dermatitidis*)、ブルメリアグラミニス(*Blumeria graminis*)、ブレミアラクツカエ(*Bremia lactucae*)、B.ドチデア(*B. dothidea*)、B.オブツサ(*B. obtusa*)のボトリオスファエリア属の一種(*Botryosphaeria spp.*)、B.シネレア(*B. cinerea*)を含むボトリチス属の一種(*Botrytis spp.*)、C.アルピカンス(*C. albicans*)、C.グラブラータ(*C. glabrata*)、C.クルセイ(*C. krusei*)、C.ルシタニエ(*C. lusitaniae*)、C.パラプシロシス(*C. parapsilosis*)、C.トロピカリス(*C. tropicalis*)のカンジダ属の一種(*Candida spp.*)、セファロアスクスフラグランス(

40

50

Cephaloascus fragrans)、セラトシスチス属の一種 (*Ceratocystis* spp)、*C. アラクジコラ* (*C. arachidicola*) を含むセルコスボラ属の一種 (*Cercospora* spp.)、セルコスボリジウムペルソナツム (*Cercosporidium personatum*)、クラドスポリウム属の一種 (*Cladosporium* spp)、クラビセブスブルブレア (*Claviceps purpurea*)、コクシジオイデスイミティス (*Coccidioides immitis*)、コクリオボルス属の一種 (*Cochliobolus* spp)、*C. ムサエ* (*C. musae*) を含むコレトトリカム属の一種 (*Colletotrichum* spp.)、クリプトコッカスネオフォルマンズ (*Cryptococcus neoformans*)、ジアポルテ属の一種 (*Diaporthe* spp)、ジディメラ属の一種 (*Didymella* spp)、ドレックスレラ属の一種 (*Drechslera* spp)、エルシノエ属の一種 (*Elsinoe* spp)、エピデルモフィトン属の一種 (*Epidermophyton* spp)、エルウィニアアミロボラ (*Erwinia amylovora*)、*E. シコラセアルム* (*E. cichoracearum*) を含むエリシフェ種 (*Erysiphe* spp.)、ユーチパラタ (*Eutypa lata*)、*F. クルモルム* (*F. culmorum*)、*F. グラミネアルム* (*F. graminearum*)、*F. ラングセチエ* (*F. langsethiae*)、*F. モニリホルメ* (*F. moniliforme*)、*F. オキシスポルム* (*F. oxysporum*)、*F. プロリフェラツム* (*F. proliferatum*)、*F. スブグルチナンス* (*F. subglutinans*)、*F. ソラニ* (*F. solani*) を含むフザリウム属の一種 (*Fusarium* spp.)、ゲーウマノミセスグラミニス (*Gaeumannomyces graminis*)、ギベラフジクロイ (*Gibberella fujikuroi*)、グロエオデスポミゲナ (*Gloeodes pomigena*)、グロエオスポリウムムサルム (*Gloeosporium musarum*)、グロメラシングレート (*Glomerella cingulate*)、ガイグナルディアビドウェリイ (*Guignardia bidwellii*)、ギムノスポランギウムジュニペリ-ヴィルギニアネ (*Gymnosporangium juniperi-virginiana*)、ヘルミントスポリウム属の一種 (*Helminthosporium* spp)、ヘミレイア属の一種 (*Hemileia* spp)、*H. カプストラツム* (*H. capsulatum*) を含むヒストプラズマ属の一種 (*Histoplasma* spp.)、ラエチサリアフシホルミス (*Laetisaria fuciiformis*)、レプトグラフィウムリンデルギ (*Leptographium lindbergii*)、レveilラタウリカ (*Leveillula taurica*)、ロフォデルミウムセディチオスム (*Lophodermium seditiosum*)、コムギ赤かび病菌 (*Microdochium nivale*)、ミクロスポルム属の一種 (*Microsporium* spp)、モニリニア属の一種 (*Monilinia* spp)、ムコール属の一種 (*Mucor* spp)、コムギ葉枯病菌 (*M. graminicola*)、*M. ポミ* (*M. pomi*) を含むミコスファエレラ属の一種 (*Mycosphaerella* spp.)、オンコバシジウムテオブロマエオン (*Oncobasidium theobromaen*)、オフィオストマピセエ (*Ophiostoma piceae*)、パラコジディオイデス属の一種 (*Paracoccidioides* spp)、*P. デジタツム* (*P. digitatum*)、*P. イタリクム* (*P. italicum*) を含むペニシリウム属の一種 (*Penicillium* spp.)、ペトリエリジウム属の一種 (*Petriellidium* spp)、*P. メイディス* (*P. maydis*)、*P. フィリピンシス* (*P. philippinensis*) および *P. ソルギ* (*P. sorghi*) を含むペロノスクレロスポラ属の一種 (*Peronosclerospora* spp.)、ペロノスポラ属の一種 (*Peronospora* spp)、コムギふ枯病菌 (*Phaeosphaeria nodorum*)、ファコブソラパチリジ (*Phakopsora pachyrhizi*)、フェリヌスイグニアルス (*Phellinus igniarius*)、フィアロフォラ属の一種 (*Phialoph*

ora spp)、フォーマ属の一種 (*Phoma* spp)、ホモブシスビティコーラ (*Phomopsis viticola*)、*P. インフェスタンス* (*P. infestans*) を含むフィットフトラ属の一種 (*Phytophthora* spp.)、*P. ハルステジイ* (*P. halstedii*)、*P. ビチコラ* (*P. viticola*) を含むプラスモパラ属の一種 (*Plasmopara* spp.)、ブレオスポラ属の一種 (*Pleospora* spp.)、リングうどんこ病菌 (*P. leucotricha*) を含むポドスファエラ属の一種 (*Podosphaera* spp.)、ポリミキサグラミニス (*Polymyxa graminis*)、ポリミキサベタエ (*Polymyxa betae*)、シュードセルコスボレラヘルポトリコイド (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、シュードモナス属の一種 (*Pseudomonas* spp) 10
P. クベンシス (*P. cubensis*)、*P. フムリ* (*P. humuli*) を含むシュードペロノスポラ属の一種 (*Pseudoperonospora* spp.)、シュードペジザトラケイフィラ (*Pseudopeziza tracheiphila*)、*P. ホルデイ* (*P. hordei*)、*P. レコンディタ* (*P. recondita*)、*P. ストリイホルミス* (*P. striiformis*)、*P. トリチシナ* (*P. tritricina*) を含むプッシニア属の一種 (*Puccinia* spp.)、ピレノペジザ属の一種 (*Pyrenopeziza* spp)、ピレノフォラ属の一種 (*Pyrenophora* spp)、イネいもち病菌 (*P. oryzae*) を含むピリクラリア属の一種 (*Pyricularia* spp.)、*P. ウルチムム* (*P. ultimum*) を含むピシウム属の一種 (*Pythium* spp.)、ラムラリア 20
 属の一種 (*Ramularia* spp)、リゾクトニア属の一種 (*Rhizoctonia* spp)、リゾムコールプシルス (*Rhizomucor pusillus*)、リゾプスアリス (*Rhizopus arrhizus*)、リンコスפורウム属の一種 (*Rhynchosporium* spp)、*S. アピオスペルムム* (*S. apiospermum*) および *S. プロリフィカンス* (*S. proliferans*) を含むセドスפורウム属の一種 (*Scedosporium* spp.)、スキゾチリウムボミ (*Schizothyrium pomi*)、スクレロチニア属の一種 (*Sclerotinia* spp)、スクレロチウム属の一種 (*Sclerotium* spp)、*S. ノドルム* (*S. nodorum*)、*S. トリティシ* (*S. tritici*) を含むセプトリア属の一種 (*Septoria* spp)、スファエロテカマクラリス (*Sphaerotheca macularis*)、スファエロテカフスカ (*Sphaerotheca fusca*) (スファエロテカフリギネア (*Sphaerotheca fuliginosa*))、スポロトリクス属の一種 (*Sporothrix* spp)、スタゴノスポラノドルム (*Stagonospora nodorum*)、ステムフィリウム属の一種 (*Stemphylium* spp.)、ステレウムヒルスツム (*Stereum hirsutum*)、タナテホルスクケメリス (*Thanatephorus cucumeris*)、チエラビオプシスバシコラ (*Thielaviopsis basicola*)、チレチア属の一種 (*Tilletia* spp)、*T. ハルジアヌム* (*T. harzianum*)、*T. シュードコニングイ* (*T. pseudokoningii*)、*T. ヴィリデ* (*T. viride*) を含むトリコデルマ属の一種 (*Trichoderma* spp) 40
 属の一種 (*Trichophyton* spp)、チフラ属の一種 (*Typhula* spp)、ウンシヌラネカトル (*Uncinula necator*)、ウロシスチス (*Urocystis* spp)、ウスチラゴ属の一種 (*Ustilago* spp)、*V. イナエクアリス* (*V. inaequalis*) を含むベンチュリア属の一種 (*Venturia* spp.)、ベルチシリウム属の一種 (*Verticillium* spp) およびキサントモナス属の一種 (*Xanthomonas* spp)。
 【0088】

式 (I) の化合物は、例えば芝生、観賞用作物、例えば花、低木、広葉樹または常緑樹、例えば針葉樹に、ならびに、樹木注入、有害生物管理などに使用され得る。

【 0 0 8 9 】

本発明の範囲内においては、保護されるべき標的作物および/または有用な植物は、典型的には、例えばブラックベリー、ブルーベリー、クランベリー、ラズベリーおよびイチゴといった液果植物；例えばオオムギ、トウモロコシ（コーン）、キビ、カラスムギ、イネ、ライ麦、モロコシ属（*sorghum*）ライコムギおよびコムギといった穀類；例えば綿、亜麻、アサ、ジュートおよびサイザルといった繊維植物；例えば糖質および飼料ビート、コーヒー、ホップ、マスタード、アブラナ（カノーラ）、ケシ、サトウキビ、ヒマワリ、チャおよびタバコといった農作物；例えばリンゴ、アンズ、アボカド、バナナ、サクランボ、柑橘類、ネクタリン、モモ、セイヨウナシおよびセイヨウスモモといった果樹；例えばパミュダグラス、イチゴツナギ、ベントグラス、センチピードグラス、ウシノケグサ、ライグラス、アメリカシバおよびノシバといった草；バジル、ルリジサ、チャイブ、コリアンダー、ラベンダー、ラベージ、ミント、オレガノ、パセリ、ローズマリー、セージおよびタイムなどのハーブ；例えばインゲンマメ、レンズマメ、エンドウマメおよびダイズ、インゲンマメといったマメ科植物；例えばアーモンド、カシュー、落花生、ヘーゼルナッツ、ピーナッツ、ペカン、ピスタチオおよびクルミといった堅果；例えばアブラヤシといったヤシ；例えば花、低木および高木といった観賞用植物；例えばカカオ、ココナツ、オリーブおよびゴムといった他の高木；例えばアスパラガス、ナス、ブロッコリ、キャベツ、ニンジン、キュウリ、ニンニク、レタス、ペポカボチャ、メロン、オクラ、タマネギ、コショウ、ジャガイモ、カボチャ、ダイオウ、ハウレンソウおよびトマトといった野菜；ならびに、例えばブドウといったつる植物などの多年生および1年生作物を含む。

10

20

【 0 0 9 0 】

「有用な植物」という用語は、従来の交配または遺伝子操作方法によって、プロモキシニルのような除草剤、または、ある分類の除草剤（例えば、HPPD抑制剤、ALS抑制剤、例えばプリスルフロン、プロスルフロンおよびトリフロキシスルフロン、EPSPS（5-エノール-ピロビル-シキメート-3-リン酸塩-シターゼ）抑制剤、GS（グルタミンシンターゼ）抑制剤またはPPO（プロトポルフィリノーゲン-オキシダーゼ）抑制剤など）に対する耐性がもたらされた有用な植物をも含むと理解されるべきである。従来の交配方法（突然変異誘発）によって、例えばイマザモックスといったイミダゾリノンに対する耐性がもたらされた作物の一例は、Clearfield（登録商標）夏ナタネ（カノーラ）である。遺伝子操作方法によって除草剤またはあるクラスの除草剤に対する耐性がもたらされた作物の例としては、商品名Roundup Ready（登録商標）、Herculex I（登録商標）およびLiberty Link（登録商標）で市販されているグリホサート-およびグルホシネート-耐性トウモロコシ品種が挙げられる。

30

【 0 0 9 1 】

「有用な植物」という用語は、トキシン-産生バクテリア、特にバチルス属（*Bacillus*）の由来として公知であるものなどの1種以上の選択的に作用するトキシンの合成能を有する、組換えDNA技術を用いることで形質転換された有用な植物を含むとも理解されるべきである。

40

【 0 0 9 2 】

このような植物の例は、Yield Gard（登録商標）（Cry IA（b）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；Yield Gard Rootworm（登録商標）（Cry IIB（b1）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；Yield Gard Plus（登録商標）（Cry IA（b）およびCry IIB（b1）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；Starlink（登録商標）（Cry 9（c）トキシンを発現するトウモロコシ品種）；Herculex I（登録商標）（Cry IF（a2）トキシンおよび酵素ホスフィトリシンN-アセチルトランスフェラーゼ（PAT）を発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成されているトウモロコシ品種）；NuCOTN 33B（登録商標）（Cry IA（c）トキシンを発現する綿品種）

50

; Bollgard I (登録商標) (CryIA(c)トキシンを発現する綿品種); Bollgard II (登録商標) (CryIA(c)およびCryIIA(b)トキシンを発現する綿品種); VIPCOT (登録商標) (VIPトキシンを発現する綿品種); NewLeaf (登録商標) (CryIIIAトキシンを発現するジャガイモ品種); NatureGard (登録商標) Agrisure (登録商標) GT Advantage (GA21グリホサート-耐性形質)、Agrisure (登録商標) CB Advantage (Bt11コーン穿孔性害虫(CB)形質)、Agrisure (登録商標) RW (コーンルートワーム形質)およびProtecta (登録商標)である。

【0093】

「作物」という用語は、例えば、トキシン-産生バクテリア、特にバチルス属 (*Bacillus*) のバクテリア由来として公知であるものなどの1種以上の選択的に作用するトキシンの合成能を有するよう、組換えDNA技術を用いることで形質転換された作物植物も含むと理解されるべきである。

【0094】

かかる形質転換植物によって発現されることが可能であるトキシンとしては、例えば、セレウス菌 (*Bacillus cereus*) またはバチルスポピリエ (*Bacillus popilliae*) 由来の殺虫性タンパク質; または、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1もしくはCry9Cといった - エンドトキシンなどのバチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 由来の殺虫性タンパク質、または、例えばVip1、Vip2、Vip3もしくはVip3Aといった栄養型殺虫性タンパク質 (*Vip*); または、フォトラダスルミネセンス (*Photobacterium luminescens*)、ゼノラダスネマトフィルス (*Xenorhabdus nematophilus*) などの、例えばフォトラダス属の一種 (*Photobacterium* spp.) もしくはゼノラダス属の一種 (*Xenorhabdus* spp.) といった線虫共生バクテリアの殺虫性タンパク質; サソリトキシン、クモトキシン、大型のハチ (*wasp*) トキシンおよび他の昆虫特異的神経トキシンなどの動物によって生成されるトキシン; ストレプトミセス (*Streptomyces*) トキシンなどの真菌によって生成されるトキシン、エンドウマメレクチン、オオムギレクチンまたはマツユキソウレクチンなどの植物レクチン; アグルチニン; トリプシン抑制剤、セリタンパク分解酵素抑制剤、パタチン、シスタチン、パバイン抑制剤などのプロテイナーゼ抑制剤; リシン、トウモロコシ-RIP、アプリン、ルフイン、サポリンまたはプリオジンなどのリポソーム-不活性化タンパク質 (RIP); 3-ヒドロキシステロイドキシダーゼ、エクジステロイド-UDP-グリコシル-トランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン抑制剤、HMG-CoA-レダクターゼなどのステロイド代謝酵素、ナトリウムまたはカルシウム遮断剤などのイオンチャネル遮断剤、幼虫ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシンターゼ、ピベンジルシンターゼ、キチナーゼおよびグルカナーゼが挙げられる。

【0095】

さらに、本発明の文脈においては、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1もしくはCry9Cといった - エンドトキシン、または、例えばVip1、Vip2、Vip3もしくはVip3Aといった栄養型殺虫性タンパク質 (*Vip*) とは、特にハイブリッドトキシン、切断型トキシンおよび修飾トキシンでもあることが理解されるべきである。ハイブリッドトキシンは、これらのタンパク質の異なるドメインの新たな組み合わせによって組換えで生成される (例えば、国際公開第02/15701号を参照のこと)。例えば切断型Cry1Abといった切断型トキシンが公知である。修飾トキシンの場合、天然トキシンの1種以上のアミノ酸が置換される。このようなアミノ酸置換において、好ましくは自然に存在しないタンパク分解酵素認識配列がトキシンに挿入され、例えば、Cry3A055の場合には、カテプシン-G-認識配列がCry3Aトキシンに挿入される (国際公開第03/0

10

20

30

40

50

18810号を参照のこと)。

【0096】

このようなトキシン、または、このようなトキシンを合成可能な形質転換植物の例が、例えば、欧州特許出願公開第0374753号明細書、国際公開第93/07278号、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0427529号明細書、欧州特許出願公開第451878号明細書および国際公開第03/052073号に開示されている。

【0097】

このような形質転換植物の調製プロセスは一般に当業者に公知であり、例えば、上記の刊行物において記載されている。Cry I - タイプデオキシリボ核酸およびその調製は、例えば、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0367474号明細書、欧州特許出願公開第0401979号明細書および国際公開第90/13651号から公知である。

10

【0098】

形質転換植物に含有されるトキシンは、有害な昆虫に対する耐性を植物に付与する。このような昆虫は昆虫の分類群のいずれかのものであることが可能であるが、特に、甲虫(鞘翅目)、双翅昆虫(双翅目)および蝶(鱗翅目)に通例見出される。

【0099】

殺虫耐性をコードし、1種以上のトキシンを発現する1種以上の遺伝子を含む形質転換植物は公知であり、そのいくつかは市販されている。このような植物の例は: Yield Gard (登録商標)(Cry1Abトキシンを発現するトウモロコシ品種); Yield Gard Rootworm (登録商標)(Cry3Bb1トキシンを発現するトウモロコシ品種); Yield Gard Plus (登録商標)(Cry1AbおよびCry3Bb1トキシンを発現するトウモロコシ品種); Starlink (登録商標)(Cry9Cトキシンを発現するトウモロコシ品種); Herculex I (登録商標)(Cry1Fa2トキシンおよび酵素ホスフィノトリシンN-アセチルトランスフェラーゼ(PAT)を発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成されているトウモロコシ品種); NuCOTN 33B (登録商標)(Cry1Actトキシンを発現する綿品種); Bollgard I (登録商標)(Cry1Actトキシンを発現する綿品種); Bollgard II (登録商標)(Cry1AcおよびCry2Abトキシンを発現する綿品種); VipCot (登録商標)(Vip3AおよびCry1Abトキシンを発現する綿品種); NewLeaf (登録商標)(Cry3Aトキシンを発現するジャガイモ品種); NatureGard (登録商標)、Agrisure (登録商標)GT Advantage (GA21グリホサート-耐性形質)、Agrisure (登録商標)CB Advantage (Bt11コーン穿孔性害虫(CB)形質)および Protecta (登録商標)である。

20

30

【0100】

このような形質転換作物のさらなる例は以下のとおりである:

1. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France 製 Bt11トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。切断型Cry1Abトキシンのトランスジェニック発現により、アワノメイガ(ヨーロッパアワノメイガ(Ostrinia nubilalis)およびセサミアノナグリオイデス(Sesamia nonagrioides))に対する耐性が付与された遺伝子操作されたトウモロコシ(Ze mays)。Bt11トウモロコシはまた、酵素PATをトランスジェニック発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成している。

40

【0101】

2. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France 製 Bt176トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。Cry1Abトキシンのトランスジェニック

50

発現によって、アワノメイガ（ヨーロッパアワノメイガ（*Ostrinia nubilalis*）およびセサミアノナグリオイデス（*Sesamia nonagrioides*））に対する耐性が付与された遺伝子操作されたトウモロコシ（*Zea mays*）。Bt176トウモロコシはまた、酵素PATをトランスジェニック発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成している。

【0102】

3. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France 製 MIR604 トウモロコシ、登録番号 C/FR/96/05/10。修飾 Cry3A トキシンのトランスジェニック発現により昆虫耐性が付与されたトウモロコシ。このトキシンは、カテブシン-G-タンパク分解酵素認識配列の挿入により修飾された Cry3A055 である。このような形質転換トウモロコシ植物の調製は、国際公開第 03/018810 号に記載されている。

10

【0103】

4. Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium 製 MON863 トウモロコシ、登録番号 C/DE/02/9。MON863 は、Cry3Bb1 トキシンを発現し、一定の鞘翅目昆虫に対する耐性を有する。

【0104】

5. Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium 製 IPC531 綿、登録番号 C/ES/96/02。

20

【0105】

6. Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium 製 1507 トウモロコシ、登録番号 C/NL/00/10。一定の鱗翅目昆虫に対する耐性を達成するタンパク質 Cry1F の発現、および、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成するための PAT タンパク質の発現のために遺伝子操作されたトウモロコシ。

【0106】

7. Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium 製 NK603 x MON810 トウモロコシ、登録番号 C/GB/02/M3/03。遺伝子操作品種 NK603 および MON810 を交配させることによる従来交配型ハイブリッドトウモロコシ品種からなる。NK603 x MON810 トウモロコシは、アグロバクテリウム属の一種（*Agrobacterium* sp.）の菌株 CP4 から得られるタンパク質 CP4 EPSPS をトランスジェニック発現し、これにより、除草剤 Roundup（登録商標）（グリホサートを含む）に対する耐性が付与され、また、バチルス・thuringiensis subsp. kurstaki から得られる Cry1Ab トキシンをトランスジェニック発現し、これにより、アワノメイガを含む一定の鱗翅目に対する耐性がもたらされる。

30

40

【0107】

本明細書において用いられるところ、「生息地（locus）」という用語は、植物が成長している圃場、または、栽培されている植物の種子が播種された圃場、または、種子が土壌に蒔かれることとなる圃場を意味する。これは、土壌、種子および実生、ならびに、確立した植生を含む。

【0108】

「植物」という用語は、種子、実生、苗、根、塊茎、茎、柄、群葉および果実を含む植物のすべての物理的な部分を指す。

【0109】

「植物繁殖体（plant propagation material）」という用語は、その増殖に用いられる

50

ことが可能である種子などの植物の生殖部、および、挿し木もしくは例えばジャガイモといった塊茎などの栄養体を表すと理解される。例えば種子（厳密な意味で）、根、果実、塊茎、鱗茎、根茎および植物の部分が挙げられ得る。発芽後もしくは土壌から出芽した後に移植されることとなる発芽した植物および若芽もまた挙げられる。これらの若芽は、移植前に浸漬による完全または部分的な処置によって保護されてもよい。好ましくは、「植物繁殖体」は種子を表すと理解される。

【0110】

式Iの化合物は、そのままの形態で、または、好ましくは、配合技術分野において簡便に採用される補助剤と一緒に用いられ得る。この目的のためにこれらは、公知の様式で、乳化性濃縮物、コーティング用ペースト、直接噴射可能もしくは希釈可能な溶液または懸濁液、希釈エマルジョン、水和剤、可溶性粉末、粉剤、粒質物、および、例えば高分子物質中のカプセルに簡便に配合され得る。組成物のタイプと同様に、吹付け、霧吹き、散粉、散布、コーティングまたは掛け流しなどの適用方法が、意図される目的およびその時点での状況に応じて選択される。組成物はまた、安定化剤、消泡剤、粘度調節剤、バインダまたは粘着剤、ならびに、肥料、微量元素の供給源、または、特別な効果を得るための他の配合物などのさらなる補助剤を含有していてもよい。

10

【0111】

例えば農業に用いられる好適なキャリアおよび補助剤は、固体または液体であることが可能であり、配合技術において有用な物質であり、例えば天然もしくは再生ミネラル物質、溶剤、分散剤、湿潤剤、粘着剤、増粘剤、バインダまたは肥料である。このようなキャリアは、例えば国際公開第97/33890号に記載されている。

20

【0112】

懸濁液濃縮物は、活性な化合物の微細な固体粒子が懸濁した水性配合物である。このような配合物は沈降防止剤および分散剤を含むと共に、活性を高めるために湿潤剤、ならびに、消泡剤および結晶成長抑制剤をさらに含み得る。使用においては、これらの濃縮物は水中で希釈され、通常は処理されるべき領域にスプレーで適用される。活性成分の量は濃縮物の0.5%~95%の範囲内であり得る。

【0113】

水和剤は、水または他の液体キャリア中に容易に分散する微細粒子の形態である。これらの粒子は、固体マトリックスに保持された活性成分を含有する。典型的な固体マトリックスとしては、フーラー土、カオリンクレイ、シリカおよび他の易湿性の有機もしくは無機固形分が挙げられる。水和剤は通常、5%~95%の活性成分と少量の湿潤剤、分散剤または乳化剤とを含有する。

30

【0114】

乳化性濃縮物は水または他の液体中に分散性である均質な液体組成物であって、活性な化合物と液体もしくは固体乳化剤とからのみ構成されていてもよく、または、キシレン、高沸点芳香族ナフサ、イソホロンおよび他の不揮発性有機溶剤などの液体キャリアを含有していてもよい。使用においては、これらの濃縮物は水または他の液体中に分散され、通常は処理されるべき領域にスプレーで適用される。活性成分の量は濃縮物の0.5%~95%の範囲内であり得る。

40

【0115】

粒状配合物は押出物および比較的粗大な粒子の両方を含み、通常は、処理が必要とされる領域に希釈されることなく適用される。粒状配合物に係る典型的なキャリアとしては、活性な化合物を吸収するか活性な化合物でコーティング可能である、砂、フーラー土、アタパルジャイトクレイ、ベントナイトクレイ、モンモリロナイトクレイ、パーミキュライト、パーライト、炭酸カルシウム、れんが、軽石、葉ろう石、カオリン、ドロマイト、焼き石膏、木粉、粉碎したトウモロコシ穂軸、粉碎したピーナッツの外殻、砂糖、塩化ナトリウム、硫酸ナトリウム、ナトリウムケイ酸、ホウ酸ナトリウム、マグネシア、雲母、酸化鉄、酸化亜鉛、酸化チタン、酸化アンチモン、水晶石、石膏、珪藻土、硫酸カルシウムおよび他の有機もしくは無機材料が挙げられる。粒状配合物は通常5%~25%の活性成

50

分を含有し、これは、高沸点芳香族ナフサ、ケロシンおよび他の石油留分などの表面活性剤、もしくは、植物油；ならびに／または、デキストリン、膠もしくは合成樹脂などの展着剤を含んでいてもよい。

【0116】

粉剤は、活性成分と、分散剤およびキャリアとして作用するタルク、クレイ、粉末ならびに他の有機および無機固形分などの微細固形分との易流動性の混和物である。

【0117】

マイクロカプセルは、典型的には、内包された材料を制御された速度で周囲に放出させることが可能である不活性の多孔性シェルに内包された活性成分の小滴または顆粒である。カプセル化された小滴は、直径が典型的には1～50ミクロンである。内包された液体は典型的には、カプセルの重量の50～95%を構成し、活性な化合物に追加して溶剤を含んでいてもよい。カプセル化された顆粒は一般に、顆粒の孔部開口をシールして、液体形態の活性種を顆粒の孔部に保持する多孔性メンブランを有する多孔性顆粒である。顆粒は典型的には、直径が1ミリメートル～1センチメートル、好ましくは1～2ミリメートルの範囲内である。顆粒は、押し出し成形、凝塊もしくはブリルによって形成されるが、または、天然のものである。このような材料の例は、パーミキュライト、焼成クレイ、カオリン、アタパルジャイトクレイ、おがくずおよび粒状炭素である。シェルまたはメンブラン材料は、天然および合成ゴム、セルロース系材料、スチレン-ブタジエンコポリマー、ポリアクリロニトリル、ポリアクリレート、ポリエステル、ポリアミド、ポリウレア、ポリウレタンおよびデンブンザンデートを含む。

10

20

【0118】

農芸化学用途に係る他の有用な配合物は、アセトン、アルキル化ナフタレン、キシレンおよび他の有機溶剤などの、所望の濃度での完全な溶解が達成される溶剤中における活性成分の単なる溶液を含む。低沸点分散剤溶剤キャリアの蒸発に伴って活性成分が微細に分離された形態に散布される加圧散布機もまた用いられ得る。

【0119】

上記の配合物タイプの本発明の組成物の配合に有用である好適な農業用補助剤およびキャリアは、当業者に周知である。

【0120】

利用可能である液体キャリアとしては、例えば、水、トルエン、キシレン、石油ナフサ油、作物油、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン、無水酢酸、アセトニトリル、アセトフェノン、酢酸アミル、2-ブタノン、クロロベンゼン、シクロヘキサノール、アルキル酢酸塩、ジアセトンアルコール、1,2-ジクロロプロパン、ジエタノールアミン、p-ジエチルベンゼン、ジエチレングリコール、ジエチレングリコールアピエテート、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1,4-ジオキサソラン、ジプロピレングリコール、ジプロピレングリコールメチルエーテル、ジプロピレングリコールジベンゾエート、ジプロキトール、アルキルピロリジノン、酢酸エチル、2-エチルヘキサノール、エチレンカーボネート、1,1,1-トリクロロエタン、2-ヘプタノン、ピネン、d-リモネン、エチレングリコール、エチレングリコールブチルエーテル、エチレングリコールメチルエーテル、-ブチロラクトン、グリセロール、グリセロール二酢酸、グリセロール酢酸、グリセロールトリアセテート、ヘキサデカン、ヘキシレングリコール、酢酸イソアミル、酢酸イソボルニル、イソオクタン、イソホロン、イソプロピルベンゼン、ミリスチン酸イソプロピル、乳酸、ラウリルアミン、メシチルオキシド、メトキシ-プロパノール、メチルイソアミルケトン、メチルイソブチルケトン、ラウリン酸メチル、オクタン酸メチル、オレイン酸メチル、塩化メチレン、m-キシレン、n-ヘキサノール、n-オクチルアミン、クタデカン酸、オクチルアミンアセテート、オレイン酸、オレイルアミン、o-キシレン、フェノール、ポリエチレングリコール(PEG400)、プロピオン酸、プロピレングリコール、プロピレングリコールモノメチルエーテル、p-キシレン、トルエン、リン酸トリエチ

30

40

50

ル、トリエチレングリコール、キシレンスルホン酸、パラフィン、鉱油、トリクロロエチレン、パークロロエチレン、酢酸エチル、酢酸アミル、酢酸ブチル、メタノール、エタノール、イソプロパノール、および、アミルアルコール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ヘキサノール、オクタノール等などの高分子量アルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、グリセリンおよびN-メチル-2-ピロリジノンが挙げられる。濃縮物の希釈には、水が一般的に選択されるキャリアである。

【0121】

好適な固体キャリアとしては、例えば、タルク、二酸化チタン、葉ろう石クレイ、シリカ、アタパルジャイトクレイ、キースラガー、チョーク、珪藻土、石灰、炭酸カルシウム、ベントナイトクレイ、フーラー土、綿実の外殻、小麦粉、ダイズ粉、軽石、木粉、クルミの外殻粉およびリグニンが挙げられる。

10

【0122】

幅広い範囲の表面活性剤が、特に適用前にキャリアで希釈されるよう設計されたものといった、前記液体および固体組成物の両方において有利に利用される。これらの表面活性剤は通常、使用される際、0.1%~15重量%の配合物を含む。これらはアニオン性、カチオン性、ノニオン性または高分子特性であることが可能であり、乳化剤、湿潤剤、懸濁剤として、または、他の目的のために利用されることが可能である。典型的な表面活性剤としては、ラウリル硫酸ジエタノールアンモニウムなどのアルキル硫酸塩；ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなどのアルキルアリアルスルホネート塩；ノニルフェノール-C_{sub}.18エトキシレートなどのアルキルフェノール-アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコール-C_{sub}.16エトキシレートなどのアルコール-アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウムなどの石鹸；ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウムなどのアルキルナフタレンスルホン酸塩；ジ(2-エチルヘキシル)スルホコハク酸ナトリウムなどのスルホコハク酸塩のジアルキルエステル；ソルビトールオレエートなどのソルビトールエステル；ラウリルトリメチル塩化アンモニウムなどの第4級アミン；ステアリン酸ポリエチレングリコールなどの脂肪酸のポリエチレングリコールエステル；エチレンオキシドおよびプロピレンオキシドのブロックコポリマー；ならびに、モノおよびジアルキルリン酸エステルの塩が挙げられる。

20

【0123】

農業用組成物において通例利用される他の補助剤としては、結晶化抑制剤、粘度変性剤、懸濁剤、噴霧粒調節剤、顔料、酸化防止剤、発泡剤、消泡剤、遮光剤、相溶化剤、消泡剤、金属イオン封鎖剤、中和剤および緩衝剤、腐食抑制剤、染料、臭気剤、展着剤、浸透補助剤、微量元素、緩和剤、潤滑剤および固着剤が挙げられる。

30

【0124】

さらに加えて、他の殺生性活性成分または組成物を、本発明の組成物と組み合わせ、本発明の方法において用い、および、本発明の組成物と同時にまたは順次に適用してもよい。同時に適用する場合、これらのさらなる活性成分は、本発明の組成物と一緒に配合されても、または、例えば、噴霧タンク中で一緒に混合されてもよい。これらのさらなる殺生性活性成分は、殺菌剤(殺真菌剤)(fungicide)、除草剤、殺虫剤、殺菌剤(bactericide)、殺ダニ剤、殺線虫剤および/または植物成長調節剤であり得る。

40

【0125】

慣用名を用いて本明細書において言及される有害生物防除剤は、例えば、“The Pesticide Manual”, 15th Ed., British Crop Protection Council 2009から公知である。

【0126】

加えて、本発明の組成物はまた、1種以上の全身獲得抵抗性誘導物質(「SAR」誘導物質)と一緒に適用され得る。SAR誘導物質は公知であって、例えば米国特許第6,919,298号明細書に記載されており、例えば、サリチル酸塩および市販されているSAR誘導物質であるアシベンゾラル-S-メチルが挙げられる。

【0127】

50

式 (I) の化合物は通常農芸化学組成物の形態で用いられ、処理されるべき作物領域または植物に、さらなる化合物と同時に、または、順次に適用されることが可能である。これらのさらなる化合物は、例えば肥料もしくは微量元素供与物、または、植物の成長に影響を及ぼす他の調製物であることが可能である。これらはまた、選択的な除草剤もしくは非選択的な除草剤、ならびに、殺虫剤、殺菌剤 (殺真菌剤)、殺菌剤、殺線虫剤、軟体動物駆除剤であることが可能であり、または、これらの調製物の数種の混合物であって、所望の場合には配合物の分野において慣例的に利用されるさらなるキャリア、界面活性剤もしくは適用促進補助剤を伴う混合物であることが可能である。

【 0 1 2 8 】

式 (I) の化合物は、活性成分として少なくとも 1 種の式 (I) の化合物を含む、植物病原性微生物に対する防除もしくは保護のための (殺菌性) 組成物の形態で用いられ得、または、遊離形態もしくは農芸化学的に使用可能な塩形態の本明細書に定義されている少なくとも 1 種の好ましい個別の化合物と、上記の補助剤の少なくとも 1 種との形態で用いられ得る。

10

【 0 1 2 9 】

本発明は従って、少なくとも 1 種の式 (I) の化合物、農学的に許容可能なキャリア、および、任意選択により補助剤を含む、組成物、好ましくは殺菌性組成物を提供する。農学的に許容可能なキャリアは、例えば農業用途に好適なキャリアである。農業用キャリアは技術分野において周知である。好ましくは、前記組成物は、式 (I) の化合物に追加して、少なくとも 1 種以上の有害生物防除的に活性な化合物、例えば追加の殺菌性活性成分を含んでいてもよい。

20

【 0 1 3 0 】

式 (I) の化合物は、組成物における唯一の活性成分であってもよく、また、適切な場合、有害生物防除剤、殺菌剤 (殺真菌剤)、共力剤、除草剤または植物成長調節剤などの 1 種以上の追加の活性成分と混合されてもよい。追加の活性成分は、いくつかの場合において、予期しない相乗的活性をもたらし得る。

【 0 1 3 1 】

好適な追加の活性成分の例としては、以下のアシルアミノ酸殺菌剤 (殺真菌剤)、脂肪族窒素殺菌剤 (殺真菌剤)、アミド殺菌剤 (殺真菌剤)、アニリド殺菌剤 (殺真菌剤)、抗生物質殺菌剤 (殺真菌剤)、芳香族殺菌剤 (殺真菌剤)、ヒ素殺菌剤 (殺真菌剤)、アリールフェニルケトン殺菌剤 (殺真菌剤)、ベンズアミド殺菌剤 (殺真菌剤)、ベンズアニリド殺菌剤 (殺真菌剤)、ベンズイミダゾール殺菌剤 (殺真菌剤)、ベンゾチアゾール殺菌剤 (殺真菌剤)、植物学的殺菌剤 (殺真菌剤)、架橋ジフェニル殺菌剤 (殺真菌剤)、カルバメート殺菌剤 (殺真菌剤)、カルバニレート殺菌剤 (殺真菌剤)、コナゾール殺菌剤 (殺真菌剤)、銅殺菌剤 (殺真菌剤)、ジカルボキシイミド殺菌剤 (殺真菌剤)、ジニトロフェノール殺菌剤 (殺真菌剤)、ジチオカルバメート殺菌剤 (殺真菌剤)、ジチオラン殺菌剤 (殺真菌剤)、フラミド殺菌剤 (殺真菌剤)、フラニリド殺菌剤 (殺真菌剤)、ヒドラジド殺菌剤 (殺真菌剤)、イミダゾール殺菌剤 (殺真菌剤)、水銀殺菌剤 (殺真菌剤)、モルホリン殺菌剤 (殺真菌剤)、有機リン殺菌剤 (殺真菌剤)、有機スズ殺菌剤 (殺真菌剤)、オキサチン殺菌剤 (殺真菌剤)、オキサゾール殺菌剤 (殺真菌剤)、フェニルスルファミド殺菌剤 (殺真菌剤)、ポリスルフィド殺菌剤 (殺真菌剤)、ピラゾール殺菌剤 (殺真菌剤)、ピリジン殺菌剤 (殺真菌剤)、ピリミジン殺菌剤 (殺真菌剤)、ピロール殺菌剤 (殺真菌剤)、第 4 級アンモニウム殺菌剤 (殺真菌剤)、キノリン殺菌剤 (殺真菌剤)、キノン殺菌剤 (殺真菌剤)、キノキサリン殺菌剤 (殺真菌剤)、ストロビルリン殺菌剤 (殺真菌剤)、スルホンアニリド殺菌剤 (殺真菌剤)、チアジアゾール殺菌剤 (殺真菌剤)、チアゾール殺菌剤 (殺真菌剤)、チアゾリジン殺菌剤 (殺真菌剤)、チオカルバメート殺菌剤 (殺真菌剤)、チオフエン殺菌剤 (殺真菌剤)、トリアジン殺菌剤 (殺真菌剤)、トリアゾール殺菌剤 (殺真菌剤)、トリアゾロピリミジン殺菌剤 (殺真菌剤)、尿素殺菌剤 (殺真菌剤)、パリンアミド殺菌剤 (殺真菌剤) および亜鉛殺菌剤 (殺真菌剤) が挙げられる。

30

40

50

【 0 1 3 2 】

好適な追加の活性成分の例としてはまた、以下が挙げられる：3 - ジフルオロメチル -
 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (9 - ジクロロメチレン - 1 , 2 , 3 ,
 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノ - ナフタレン - 5 - イル) - アミド、3 - ジフルオロ
 メチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸メトキシ - [1 - メチル - 2 -
 (2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) - エチル] - アミド、1 - メチル - 3 - ジフルオロ
 メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (2 - ジクロロメチレン - 3 - エチル - 1 -
 メチル - インダン - 4 - イル) - アミド (1 0 7 2 9 5 7 - 7 1 - 1)、1 - メチル - 3
 - ジフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (4 ' - メチルスルファニル -
 ビフェニル - 2 - イル) - アミド、1 - メチル - 3 - ジフルオロメチル - 4 H - ピラゾール 10
 ル - 4 - カルボン酸 [2 - (2 , 4 - ジクロロ - フェニル) - 2 - メトキシ - 1 - メチル
 - エチル] - アミド、(5 - クロロ - 2 , 4 - ジメチル - ピリジン - 3 - イル) - (2 ,
 3 , 4 - トリメトキシ - 6 - メチル - フェニル) - メタノン、(5 - プロモ - 4 - クロロ
 - 2 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル) - (2 , 3 , 4 - トリメトキシ - 6 - メチル - フ
 ェニル) - メタノン、2 - { 2 - [(E) - 3 - (2 , 6 - ジクロロ - フェニル) - 1 -
 メチル - プロブ - 2 - エン - (E) - イリデンアミノオキシメチル] - フェニル } - 2 -
 [(Z) - メトキシイミノ] - N - メチル - アセトアミド、3 - [5 - (4 - クロロ - フ
 ェニル) - 2 , 3 - ジメチル - イソキサゾリン - 3 - イル] - ピリジン、(E) - N - メ
 チル - 2 - [2 - (2 , 5 - ジメチルフェノキシメチル) フェニル] - 2 - メトキシ - イ
 ミノアセタミド、4 - プロモ - 2 - シアノ - N , N - ジメチル - 6 - トリフルオロメチル 20
 ベンズイミダゾール - 1 - スルホンアミド、a - [N - (3 - クロロ - 2 , 6 - キシリル
) - 2 - メトキシアセタミド] - y - ブチロラクトン、4 - クロロ - 2 - シアノ - N , N
 - ジメチル - 5 - p - トリルイミダゾール - 1 - スルホンアミド、N - アリル - 4 , 5 ,
 - ジメチル - 2 - トリメチルシリルチオフエン - 3 - カルボキサミド、N - (1 - シアノ
 - 1 , 2 - ジメチルプロピル) - 2 - (2 , 4 - ジクロロフェノキシ) プロピオンアミド
 、N - (2 - メトキシ - 5 - ピリジル) - シクロプロパンカルボキサミド、(. + .)
 - c i s - 1 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 -
 イル) - シクロヘプタノール、2 - (1 - t - ブチル) - 1 - (2 - クロロフェニル) -
 3 - (1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) - プロパン - 2 - オール、2 ' , 6 ' - ジ
 プロモ - 2 - メチル - 4 - トリフルオロメトキシ - 4 ' - トリフルオロメチル - 1 , 3 - 30
 チアゾール - 5 - カルボキシアニリド、1 - イミダゾリル - 1 - (4 ' - クロロフェノキ
 シ) - 3 , 3 - ジメチルブタン - 2 - オン、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - シア
 ノフェノキシ) ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル] 3 - メトキシアクリレート、メ
 チル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - チオアミドフェノキシ) ピリミジン - 4 - イルオキ
 シ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - フ
 ルオロフェノキシ) ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレー
 ト、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 , 6 - ジフルオロフェノキシ) ピリミジン - 4
 - イルオキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3
 - (ピリミジン - 2 - イルオキシ) フェノキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート
 、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (5 - メチルピリミジン - 2 - イルオキシ) - フェノ
 キシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (フェ
 ニル - スルホニルオキシ) フェノキシ] フェニル - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E)
 - 2 - [2 - [3 - (4 - ニトロフェノキシ) フェノキシ] フェニル] - 3 - メトキシ
 アクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - フェノキシフェニル] - 3 - メトキシアクリ
 レート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 , 5 - ジメチル - ベンゾイル) ピロール - 1 - イ
 ル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - メトキシフェノキシ)
 フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 [2 - (2 - フェニルエテ
 ン - 1 - イル) - フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (40
 3 , 5 - ジクロロフェノキシ) ピリジン - 3 - イル] - 3 - メトキシアクリレート、メチ
 ル (E) - 2 - (2 - (3 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ) フェノキシ)

10

20

30

40

50

フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - (2 - [3 - (- ヒドロキシベンジル)フェノキシ]フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - (2 - (4 - フェノキシピリジン - 2 - イルオキシ)フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - n - プロピルオキシ - フェノキシ)フェニル] 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - イソプロピルオキシフェノキシ)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (2 - フルオロフェノキシ)フェノキシ]フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - エトキシフェノキシ)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (4 - t - ブチル - ピリジン - 2 - イルオキシ)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (3 - シアノフェノキシ)フェノキシ]フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [(3 - メチル - ピリジン - 2 - イルオキシメチル)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - メチル - フェノキシ)ピリミジン - 4 - イルオキシ]フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (5 - プロモ - ピリジン - 2 - イルオキシメチル)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - (3 - ヨードピリジン - 2 - イルオキシ)フェノキシ)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - クロロピリジン - 3 - イルオキシ)ピリミジン - 4 - イルオキシ]フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) , (E) - 2 - [2 - (5 , 6 - ジメチルピラジン - 2 - イルメチルオキシミノメチル)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - {2 - [6 - (6 - メチルピリジン - 2 - イルオキシ)ピリミジン - 4 - イルオキシ]フェニル} - 3 - メトキシ - アクリレート、メチル (E) , (E) - 2 - {2 - (3 - メトキシフェニル)メチルオキシミノメチル] - フェニル} - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - {2 - (6 - (2 - アジドフェノキシ) - ピリミジン - 4 - イルオキシ]フェニル} - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) , (E) - 2 - {2 - [6 - フェニルピリミジン - 4 - イル) - メチルオキシミノメチル]フェニル} - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) , (E) - 2 - {2 - [(4 - クロロフェニル) - メチルオキシミノメチル] - フェニル} - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - {2 - [6 - (2 - n - プロピルフェノキシ) - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 4 - イルオキシ]フェニル} - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) , (E) - 2 - {2 - [(3 - ニトロフェニル)メチルオキシミノメチル]フェニル} - 3 - メトキシアクリレート、3 - クロロ - 7 - (2 - アザ - 2 , 7 , 7 - トリメチル - オクタ - 3 - エン - 5 - イン)、2 , 6 - ジクロロ - N - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - ベンズアミド、3 - ヨード - 2 - プロピニルアルコール、4 - クロロフェニル - 3 - ヨードプロパルギルホルマル、3 - プロモ - 2 , 3 - ジヨード - 2 - プロピニルエチルカルバメート、2 , 3 , 3 - トリヨードアリルアルコール、3 - プロモ - 2 , 3 - ジヨード - 2 - プロピニルアルコール、3 - ヨード - 2 - プロピニル n - ブチルカルバメート、3 - ヨード - 2 - プロピニル n - ヘキシルカルバメート、3 - ヨード - 2 - プロピニルシクロヘキシル - カルバメート、3 - ヨード - 2 - プロピニルフェニルカルバメート; トリプロモフェノール、テトラクロロフェノール、3 - メチル - 4 - クロロフェノール、3 , 5 - ジメチル - 4 - クロロフェノール、フェノキシエタノール、ジクロロフェン、o - フェニルフェノール、m - フェニルフェノール、p - フェニルフェノール、2 - ベンジル - 4 - クロロフェノール、5 - ヒドロキシ - 2 (5 H) - フラノンなどのフェノール; 4 , 5 - ジクロロジチアゾリノン、4 , 5 - ベンゾジチアゾリノン、4 , 5 - トリメチレンジチアゾリノン、4 , 5 - ジクロロ - (3 H) - 1 , 2 - ジチオール - 3 - オン、3 , 5 - ジメチル - テトラヒドロ - 1 , 3 , 5 - チアジアジン - 2 - チオン、N - (2 - p - クロロベンゾイルエチル) - ヘキサミニウムクロリド、アシベンゾラル、アシペタックス、アラニカルブ、アルベンダゾール、アルジモルフ、アリシン、アリルアルコール、アメトクトラジン、アミスルプロム、アモバム、アンプロピルホス、アニラジン、アソメート、オーレオフンギン、アザコナゾール、アザフェンジン、アジチラム、アゾキシストロピン、バリウムポリスルフィド、ベナラキシル、ベナラキ

10

20

30

40

50

シル - M、ベノダニル、ベノミル、ベンキノックス、ベントルロン、ベンチアバリカルブ、
 ベンチアゾール、塩化ベンザルコニウム、ベンザマクリル、ベンザモルフ、ベンゾヒド
 ロキサム酸、ベンゾビンジフルピル、ベルベリン、ベトキサジン、ピロキサゾール、ピナ
 パクリル、ピフェニル、ピテルタノール、ピチオノール、ピキサフェン、プラストサイジ
 ン - S、ボスカリド、プロモタロニル、プロムコナゾール、ピリメート、プチオベート
 、プチルアミン多硫酸カルシウム、カプタホール、キャプタン、カルバモルフ、カルベン
 ダジム、カルベンダジムクロリドレート、カルボキシシ、カルプロバミド、カルボン、C
 G A 4 1 3 9 6、C G A 4 1 3 9 7、キノメチオネート、キトサン、クロベンチアゾン、
 クロラニホルメタン、クロラニル、クロルフエナゾール、クロロネブ、クロルピクリン、
 クロロタロニル、クロロゾリネート、クロゾリネート、クリンバゾール、クロトリマゾール
 10
 ル、クロジラコン、酢酸銅、炭酸銅、水酸化銅、ナフテン酸銅、オレイン酸銅、オキシ塩
 化銅、オキシキノリン酸銅、ケイ酸銅、硫酸銅、タル油酸銅、クロム酸銅亜鉛およびボル
 ドー液などの銅含有化合物、クレゾール、クフラエブ、クプロバム、酸化第一銅、シアゾ
 ファミド、シクラフラミド、シクロヘキシミド、シフルフェナミド、シモキサニル、シペ
 ンダゾール、シプロコナゾール、シプロジニル、ダゾメット、デバカルブ、デカフェンチ
 ン、デヒドロ酢酸、ジ - 2 - ピリジルジスルフィド 1, 1' - ジオキシド、ジクロフルア
 ニド、ジクロメジン、ジクロン、ジクロラン、ジクロロフェン、ジクロゾリン、ジクロブ
 トラゾール、ジクロシメット、ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジフェンゾコ
 ート、ジフルメトリム、O, O - ジ - イソ - プロピル - S - ベンジルチオホスフェート、
 ジメフルアゾール、ジメタクロン、ジメトコナゾール、ジメトモルフ、ジメチリモール、
 20
 ジニコナゾール、ジニコナゾール - M、ジノブトン、ジノカップ、ジノクトン、ジノペン
 トン、ジノスルホン、ジノテルボン、ジフェニルアミン、ジピリチオン、ジスルフィラム
 、ジタリムホス、ジチアノン、ジチオエーテル、ドデシルジメチル塩化アンモニウム、ド
 デモルフ、ドジチン、ドジン、ドグアジン、ドラゾキソロン、エディフェンホス、エネス
 トロブリン、エポキシコナゾール、エタコナゾール、エテム、エタボキサム、エチリモ
 ール、エトキシキン、エチリシン、エチル (Z) - N - ベンジル - N ([メチル (メチル -
 チオエチリデンアミノ - オキシカルボニル) アミノ] チオ) - アラニナト、エトリジ
 アゾール、ファミキサドン、フェンアミドン、フェナミノスルフ、フェナパニル、フェナ
 リモル、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェンヘキサミド、フェニトロパン、フェ
 ノ
 30
 キサニル、フェンピクロニル、フェンピコキサミド、フェンプロビジン、フェンプロピモ
 ルフ、フェンピラザミン、酢酸トリフェニルスズ、トリフェニルスズヒドロキシド、フェ
 ルバム、フェリムゾン、フルアジナム、フルジオキシニル、フルメトベル (f l u m e t
 o v e r)、フルモルフ、フルピコリド、フルオピラム、フルオロイミド、フルトリマゾ
 ール、フルオキサストロピン、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルスルファミド
 、フルタニル、フルトラニル、フルトリアホール、フルキサピロキサド、ホルベット、ホ
 ルムアルデヒド、ホセチル、フベリダゾール、フララキシル、フラメトピル、フルカルバ
 ニル、フルコナゾール、ルフラール、フルメシクロックス、フロファネート、グリオジン
 、グリセオフラビン、グアザチン、ハラクリネート、ヘキサクロロベンゼン、ヘキサクロ
 ロブタジエン、ヘキサクロロフェン、ヘキサコナゾール、ヘキシルチオホス、ヒドラルガ
 フェン、ヒドロキシイソキサゾール、ヒメキサゾール、イマザリル、硫酸イマザリル、イ
 ミベンコナゾール、イミノクタジン、三酢酸イミノクタジン、イネジン、ヨードカルブ、
 イブコナゾール、イブフェントリフルコナゾール、イプロベンホス、イプロジオン、イブ
 ロバリカルブ、イソプロパニルブチルカルバメート、イソプロチオラン、イソピラザム、
 イソチアニル、イソバレジオン、イゾパムホス、カスガマイシン、クレソキシム - メチル
 、L Y 1 8 6 0 5 4、L Y 2 1 1 7 9 5、L Y 2 4 8 9 0 8、マンコゼブ、マンジプロバ
 ミド、マンネブ、メベニル、メカルピンジド、メフェノキサム、メフェントリフルコナゾ
 ール、メパニピリム、メプロニル、塩化第二水銀、塩化第一水銀、メブチルジノカップ、
 メタラキシル、メタラキシル - M、メタム、メタゾキソロン、メトコナゾール、メタスル
 ホカルブ、メタフロキサム、臭化メチル、ヨウ化メチル、メチルイソチオシアネート、メ
 50

チラム、メチラム - 亜鉛、メトミノストロピン、メトラフェノン、メツルホバクス、ミルネブ、モロキシジン、マイクロブタニル、マイクロゾリン、ナーバム、ナタミシン、ネオアソジン、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、ニトロスチレン、ニトロタル - イソ - プロピル、ヌアリモル、オクチリノン、オフレース、有機水銀化合物、オリザストロピン、オストール、オキサジキシル、オキサスルフロム、オキサチアピプロリン、オキシ銅、オキソリン酸、オキスポコナゾール、オキシカルボキシ、パリノール、ペフラゾエート、ペンコナゾール、ペンシクロン、ペンフルフェン、ペンタクロロフェノール、ペンチオピラド、フェナマクリル、フェナジンオキシド、ホスジフェン、ホセチル - A 1、リン酸、フタリド、ピコキシストロピン、ピペラリン、ポリカルバメート、ポリオキシ D、ポリオキシリム、ポリラム、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロバミジン、プロパモカルブ、プロピコナゾール、プロピネブ、プロピオン酸、プロキナジド、プロチオカルブ、プロチオコナゾール、ピジフルメトフェン、ピラカルボリド、ピラクロストロピン、ピラメトロストロピン、ピラオキシストロピン、ピラゾホス、ピリベンカルブ、ピリジニトリル、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピリオフェノン、ピロキロン、ピロキシクロール、ピロキシフル、ピロールニトリン、第 4 級アンモニウム化合物、キナセトール、キナザミド、キンコナゾール、キノメチオネート、キノキシフェン、キントゼン、ラベンザゾール、サントニン、セダキサ、シルチオファム、シメコナゾール、シブコナゾール、5 塩化石炭酸ナトリウム、スピロキサミン、ストレプトマイシン、硫黄、スルトロベン、テブコナゾール、テブフロキン、テクロフタラム、テクナゼン、テコラム、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チアジフロル、チシオフエン、チフルザミド、2 - (チオシアノメチルチオ) ベンゾチアゾール、チオフアネート - メチル、チオキノックス、チラム、チアジニル、チミベンコナゾール、チオキサミド、トルコホス - メチル、トリルフルアニド、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアミホス、トリアリモル、トリアズブチル、トリアゾキシド、トリシクラゾール、トリデモルフ、トリフロキシストロピン、トリフルマゾール、トリホリン、トリフルミゾール、トリチコナゾール、ウニコナゾール、ウルバシド、バリダマイシン、バリフェナレート、ババム、ピンクロゾリン、ザリルアミド、ジネブ、ジラム、およびゾキサミド。

10

20

30

40

【 0 1 3 3 】

本発明の化合物はまた、駆虫薬薬剤との組み合わせで用いられ得る。このような駆虫薬としては、欧州特許第 3 5 7 4 6 0 号明細書、欧州特許第 4 4 4 9 6 4 号明細書および欧州特許第 5 9 4 2 9 1 号明細書に記載されているとおり、イベルメクチン、アベルメクチン、アバメクチン、エマメクチン、エピリノメクチン、ドラメクチン、セラメクチン、モキシデクチン、ネマデクチンおよびミルベマイシン誘導体などの化合物の大環式ラクトンクラスから選択される化合物が挙げられる。追加の駆虫薬としては、米国特許第 5 0 1 5 6 3 0 号明細書、国際公開第 9 4 1 5 9 4 4 号および国際公開第 9 5 2 2 5 5 2 号に記載されているものなどの半合成および生合成アベルメクチン/ミルベマイシン誘導体が挙げられる。追加の駆虫薬としては、アルベンダゾール、カンベンダゾール、フェンベンダゾール、フルベンダゾール、メベンダゾール、オキシフェンダゾール、オキシベンダゾール、パルベンダゾール、および、このクラスの他の構成要素などのベンズイミダゾールが挙げられる。追加の駆虫薬としては、イミダゾチアゾール、および、テトラミソール、レバミゾール、パモ酸ピランテル (p y r a n t e l p a m o a t e)、オキサニルまたはモランテルなどのテトラヒドロピリミジンが挙げられる。追加の駆虫薬としては、トリクラベンダゾールおよびクロルスロンなどのフルキシド、ならびに、ブラジカンテルおよびエブシプランテルなどのセストサイド (c e s t o c i d e) が挙げられる。

【 0 1 3 4 】

本発明の化合物は、パラヘルクアミド/マルクホルチンクラスの駆虫薬の誘導体および類似体、ならびに、米国特許第 5 4 7 8 8 5 5 号明細書、米国特許第 4 6 3 9 7 7 1 号明細書および独国特許第 1 9 5 2 0 9 3 6 号明細書に開示されているものなどの抗寄生虫性オキサゾリンとの組み合わせで用いられ得る。

【 0 1 3 5 】

50

本発明の化合物は、国際公開第96/15121号に記載されている一般的なクラスのジオキソモルホリン抗寄生虫性薬剤の誘導体および類似体との組み合わせで、また、国際公開第96/11945号、国際公開第93/19053号、国際公開第93/25543号、欧州特許第0626375号明細書、欧州特許第0382173号明細書、国際公開第94/19334号、欧州特許第0382173号明細書、および、欧州特許第0503538号明細書に記載のものなどの駆虫活性環式デブシペプチドとの組み合わせで用いられ得る。

【0136】

本発明の化合物は、他の外寄生生物撲滅薬；例えば、フィプロニル；ピレスロイド；有機リン酸エステル；ルフェヌロンなどの昆虫成長調節剤；テブフェノジド等などのエクジソンアゴニスト；イミダクロプリド等などのネオニコチノイドとの組み合わせで用いられ得る。

10

【0137】

本発明の化合物は、例えば国際公開第95/19363号または国際公開第04/72086号に記載のものといったテルペンアルカロイドであって、特にこれらに開示の化合物との組み合わせで用いられ得る。

【0138】

本発明の化合物が組み合わせられて用いられ得るこのような生物学的に有効な化合物の他の例としては、これらに限定されることはないが、以下が挙げられる。

有機リン酸エステル：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、プロモホス、プロモホス - エチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルピリホス、クロルフェンピンホス、クロルメホス、デメトン、デメトン - S - メチル、デメトン - S - メチルスルホン、ジアリホス、ダイアジノン、ジクロルボス、ジクロトホス、ジメトエート、ジスルホトン、エチオン、エトプロホス、エトリムホス、ファンファー、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンスルホチオン、フェンチオン、フルピラゾホス、フォノホス、ホルモチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イサゾホス、イソチオエート、イソキサチオン、マラチオン、メタクリホス、メタミドホス、メチダチオン、メチル - パラチオン、メピンホス、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、パラオキソン、パラチオン、パラチオン - メチル、フェントエート、ホサロン、ホスホラン、ホスホカルブ、ホスメット、ホスファミドン、ホレート、ホキシム、ピリミホス、ピリミホス - メチル、プロフェノホス、プロバホス、プロエタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダペンチオン、キナルホス、スルプロホス、テムホス、テルブホス、テブピリムホス、テトラクロルピンホス、チメトン (thimeton)、トリアゾホス、トリクロルホン、パミドチオン。

20

30

【0139】

カルバメート：アラニカルブ、アルジカルブ、2 - sec - ブチルフェニルメチルカルバメート、ベンフラカルブ、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、クロエトカルブ、エチオフエンカルブ、フェノキシカルブ、フェンチオカルブ、フラチオカルブ、HCN - 801、イソプロカルブ、インドキサカルブ、メチオカルブ、メソミル、5 - メチル - m - クメニルブチリル (メチル) カルバメート、オキサミル、ピリミカーブ、プロボキスル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、UC - 51717。

40

【0140】

ピレスロイド：アクリナチン (acrinathin)、アレトリン、アルファメトリン (alphametrin)、5 - ベンジル - 3 - フリルメチル (E) - (1R) - シス - 2, 2 - ジメチル - 3 - (2 - オキソチオラン - 3 - イリデンメチル) シクロプロパンカルボキシレート、ピフェントリン、 - シフルトリン、シフルトリン、 - シペルメトリン、 - シペルメトリン、ピオアレトリン、ピオアレトリン ((S) - シクロペンチル異性体)、ピオレスメトリン、ピフェントリン、NCI - 85193、シクロプロトリン、シハロトリン、シチトリン、シフェノトリン、デルタメトリン、エムペントリン、エスフェンバレレート、エトフェンプロクス、フェンフルトリン、フェンプロバトリン、フ

50

エンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、フルバリネート（D異性体）、イミプロトリン、シハロトリン、*l*-シハロトリン、ペルメトリン、フェノトリン、プラレトリン、ピレトリン（天然生成物）、レスメスリン、テトラメトリン、トランスフルトリン、*l*-シベルメトリン、シラフルオフエン、*t*-フルバリネート、テフルトリン、トラロメトリン、*l*-シベルメトリン。

【0141】

節足動物成長調節剤：a) キチン合成抑制剤：ベンゾイル尿素：クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルアズロン、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、テフルベンズロン、トリフルムロン、ブプロフェジン、ジオフェノラン、ヘキシチアゾクス、エトキサゾール、クロルフェンタジン；b) エクジソンアンタゴニスト：ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テブフェノジド；c) ジュベノイド：ピリプロキシフェン、メトブレン（S-メトブレンを含む）、フェノキシカルブ；d) 脂質生合成抑制剤：スピロジクロフェン。

10

【0142】

他の抗寄生虫薬：アセキノシル、アミトラズ、AKD-1022、ANS-118、アザジラクチン、パチルスチューリングゲンシス（*Bacillus thuringiensis*）、ベンサルタップ、ピフェナゼート、ピナバクリル、プロモプロピレート、BTG-504、BTG-505、カンフェクロール、カルタップ、クロロベンジレート、クロルジメホルム、クロルフェナビル、クロマフェノジド、クロチアニジン（clothianidine）、シロマジン、ジアクロデン、ジアフェンチウロン、DBI-3204、ジナクチン、ジヒドロキシメチルジヒドロキシピロリジン、ジノブトン、ジノカップ、エンドスルファン、エチプロール、エトフェンプロクス、フェナザキン、フルマイト、MTI-800、フェンピロキシメート、フルアクリピリム、フルベンジミン、フルプロシトリネート、フルフェンジン、フルフェンブロックス、フルプロキシフェン、ハロフェンブロックス（halofenprox）、ヒドラメチルノン、IKI-220、カネマイト、NC-196、ニームガード、ニジノルテルフラン、ニテンピラム、SD-35651、WL-108477、ピリダリル、プロパルギット、プロトリフェンプト、ピメトロジン（pymethrozine）、ピリダベン、ピリミジフェン、NC-1111、R-195、RH-0345、RH-2485、RYI-210、S-1283、S-1833、SI-8601、シラフルオフエン、シロマジン、スピノサド、テブフェンピラド、テトラジホン、テトラナクチン（tetranactin）、チアクロブリド、チオシクラム、チアメトキサム、トルフェンピラド、トリアザメート、トリエトキシスピノシン、トリナクチン、ベルブチン、ベルタレク、YI-5301。

20

30

【0143】

生物剤：パチルスチューリングゲンシス（*Bacillus thuringiensis* ssp *aizawai*, *kurstaki*）、パチルスチューリングゲンシス（*Bacillus thuringiensis*） エンドトキシン、バキュロウイルス、昆虫病原性バクテリア、ウイルスおよび真菌。

【0144】

殺菌剤：クロルテトラサイクリン、オキシテトラサイクリン、ストレプトマイシン。

40

【0145】

他の生物剤：エンロフロキサシン、フェバンテル、ペネタメート、モロキシカム、セファレキシン、カナマイシン、ピモベンダン、クレンブテロール、オメブラゾール、チアムリン、ベナゼプリル、ピリプロール、セフキノム、フロルフェニコール、ブセレリン、セフォベシン、ツラスロマイシン、セフチオウル、カルプロフェン、メタフルミゾン、ブラジクアランテル、トリクラベンダゾール。

【0146】

式（I）の化合物と活性成分との以下の混合物が好ましい。略記「TX」は：表1.1～1.12もしくは表T1（以下）；表2.1～2.4もしくは表T2（以下）；表3.1～3.6もしくは表T3（以下）；または、表T4（以下）に記載されている化合物が

50

らなる群から選択される1種の化合物を意味する。

【0147】

石油(代替名)(628)+TXからなる物質群から選択される補助剤、

1,1-ビス(4-クロロフェニル)-2-エトキシエタノール(IUPAC名)(910)+TX、2,4-ジクロロフェニルベンゼンスルホネート(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1059)+TX、2-フルオロ-N-メチル-N-1-シナムアルデヒド(IUPAC名)(1295)+TX、4-クロロフェニルフェニルスルホン(IUPAC名)(981)+TX、アバメクチン(1)+TX、アセキノシル(3)+TX、アセトプロール[CCN]+TX、アクリナトリン(9)+TX、アルジカルブ(16)+TX、アルドキシカルブ(863)+TX、-シベルメトリン(202)+TX、アミジチオン(870)+TX、アミドフルメト[CCN]+TX、アミドチオエート(872)+TX、アミトン(875)+TX、シュウ酸水素アミトン(875)+TX、アミトラズ(24)+TX、アラマイト(881)+TX、三酸化ヒ素(882)+TX、AVI382(化合物コード)+TX、AZ60541(化合物コード)+TX、アジンホス-エチル(44)+TX、アジンホス-メチル(45)+TX、アゾベンゼン(IUPAC名)(888)+TX、アゾシクロチン(46)+TX、アゾトエート(889)+TX、ベノミル(62)+TX、ベノキサホス(代替名)[CCN]+TX、ベンゾキメート(71)+TX、ベンジル安息香酸塩(IUPAC名)[CCN]+TX、ピフェナゼート(74)+TX、ピフェントリン(76)+TX、ピナバクリル(907)+TX、プロフェンバレート(代替名)+TX、プロモシクレン(918)+TX、プロモホス(920)+TX、プロモホス-エチル(921)+TX、プロモプロピレート(94)+TX、プロロフェジン(99)+TX、プトカルボキシム(103)+TX、プトキシカルボキシム(104)+TX、プチルピリダベン(代替名)+TX、多硫酸カルシウム(IUPAC名)(111)+TX、カンフェクロール(941)+TX、カルバノレート(943)+TX、カルバリル(115)+TX、カルボフラン(118)+TX、カルボフェノチオン(947)+TX、CGA50'439(開発コード)(125)+TX、キノメチオネート(126)+TX、クロルベンシド(959)+TX、クロルジメホルム(964)+TX、クロルジメホルムヒドロクロリド(964)+TX、クロルフェナピル(130)+TX、クロルフェネトール(968)+TX、クロルフェンソン(970)+TX、クロルフェンスルフィド(971)+TX、クロルフェンピンホス(131)+TX、クロロベンジラート(975)+TX、クロロメブホルム(977)+TX、クロロメチウロン(978)+TX、クロロプロピレート(983)+TX、クロルピリホス(145)+TX、クロルピリホス-メチル(146)+TX、クロルチオホス(994)+TX、シネリンI(696)+TX、シネリンII(696)+TX、シネリンス(696)+TX、クロフェンテジン(158)+TX、クロサンテル(代替名)[CCN]+TX、クマホス(174)+TX、クロタミトン(代替名)[CCN]+TX、クロトキシホス(1010)+TX、クフラエブ(1013)+TX、シアントエート(1020)+TX、シフルメトフェン(CAS登録番号:400882-07-7)+TX、シハロトリン(196)+TX、シヘキサチン(199)+TX、シベルメトリン(201)+TX、DCPM(1032)+TX、DDT(219)+TX、デメフィオン(1037)+TX、デメフィオン-O(1037)+TX、デメフィオン-S(1037)+TX、デメトン(1038)+TX、デメトン-メチル(224)+TX、デメトン-O(1038)+TX、デメトン-O-メチル(224)+TX、デメトン-S(1038)+TX、デメトン-S-メチル(224)+TX、デメトン-S-メチルスルホン(1039)+TX、ジアフェンチウロン(226)+TX、ジアリホス(1042)+TX、ダイアジノン(227)+TX、ジクロフルアニド(230)+TX、ジクロルボス(236)+TX、ジクリホス(代替名)+TX、ジコホル(242)+TX、ジクロトホス(243)+TX、ジエノクロル(1071)+TX、ジメホクス(1081)+TX、ジメトエート(262)+TX、ジナクチン(代替名)(653)+TX、ジネクス(1089)+TX、ジネクスジクレキシム(108

10

20

30

40

50

9) + TX、ジノブトン (269) + TX、ジノカップ (270) + TX、ジノカップ -
 4 [CCN] + TX、ジノカップ - 6 [CCN] + TX、ジノクトン (1090) + TX
 、ジノペントン (1092) + TX、ジノスルホン (1097) + TX、ジノテルボン (1098) + TX、ジオキサチオン (1102) + TX、ジフェニルスルホン (IUPAC名) (1103) + TX、ジスルフィラム (代替名) [CCN] + TX、ジスルホトン (278) + TX、DNOC (282) + TX、ドフェナピン (1113) + TX、ドラ
 メクチン (代替名) [CCN] + TX、エンドスルファン (294) + TX、エンドチオ
 ン (1121) + TX、EPN (297) + TX、エピリノメクチン (代替名) [CCN
] + TX、エチオン (309) + TX、エトエートメチル (1134) + TX、エトキサ
 ゴール (320) + TX、エトリムホス (1142) + TX、フェナザフロル (1147 10
) + TX、フェナザキン (328) + TX、酸化フェンブタズ (330) + TX、フェ
 ノチオカルブ (337) + TX、フェンプロパトリン (342) + TX、フェンピラド (代
 替名) + TX、フェンピロキシメート (345) + TX、フェンソン (1157) + T
 X、フェントリファニル (1161) + TX、フェンバレレート (349) + TX、フィ
 プロニル (354) + TX、フルアクリピリム (360) + TX、フルアズロン (116
 6) + TX、フルベンジミン (1167) + TX、フルシクロクスロン (366) + TX
 、フルシトリネート (367) + TX、フルエネチル (1169) + TX、フルフェノク
 スロン (370) + TX、フルメトリン (372) + TX、フルオルベンシド (1174
) + TX、フルバリネート (1184) + TX、FMC 1137 (開発コード) (118
 5) + TX、ホルメタネート (405) + TX、ホルメタネートヒドロクロリド (405 20
) + TX、ホルモチオン (1192) + TX、ホルムパラネート (1193) + TX、
 - HCH (430) + TX、グリオジン (1205) + TX、ハルフェンブロクス (42
 4) + TX、ヘプテノホス (432) + TX、ヘキサデシルシクロプロパンカルボキシレ
 ート (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (1216) + TX、ヘ
 キシチアゾクス (441) + TX、ヨードメタン (IUPAC 名) (542) + TX、イ
 ソカルボホス (代替名) (473) + TX、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 (IUPAC 名) (473) + TX、イベルメクチン (代替名) [C
 CN] + TX、ジャスモリン I (696) + TX、ジャスモリン II (696) + TX
 、ジヨドフェンホス (1248) + TX、リンダン (430) + TX、ルフエヌロン (4
 90) + TX、マラチオン (492) + TX、マロノベン (1254) + TX、メカルバ 30
 ム (502) + TX、メホスフォラン (1261) + TX、メスルフェン (代替名) [C
 CN] + TX、メタクリホス (1266) + TX、メタミドホス (527) + TX、メチ
 ダチオン (529) + TX、メチオカルブ (530) + TX、メソミル (531) + TX
 、臭化メチル (537) + TX、メトルカルブ (550) + TX、メビンホス (556)
 + TX、メキサカルベート (1290) + TX、ミルベメクチン (557) + TX、ミル
 ベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX、ミバホクス (1293) + TX、
 モノクロトホス (561) + TX、モルホチオン (1300) + TX、モキシデクチン (代
 替名) [CCN] + TX、ナレド (567) + TX、NC - 184 (化合物コード) +
 TX、NC - 512 (化合物コード) + TX、ニフルリジド (1309) + TX、ニッコ
 マイシン (代替名) [CCN] + TX、ニトリラカルブ (1313) + TX、ニトリラカ 40
 ルブ 1 : 1 塩化亜鉛錯体 (1313) + TX、NNI - 0101 (化合物コード) + TX
 、NNI - 0250 (化合物コード) + TX、オメトエート (594) + TX、オキサミ
 ル (602) + TX、オキシデプロホス (1324) + TX、オキシジスルホトン (13
 25) + TX、pp' - DDT (219) + TX、パラチオン (615) + TX、ペルメ
 トリン (626) + TX、石油 (代替名) (628) + TX、フェンカプトン (1330
) + TX、フェントエート (631) + TX、ホレート (636) + TX、ホサロン (6
 37) + TX、ホスホラン (1338) + TX、ホスメット (638) + TX、ホスファ
 ミドン (639) + TX、ホキシム (642) + TX、ピリミホス - メチル (652) +
 TX、ポリクロロテルペン (慣習名) (1347) + TX、ポリナクチン (代替名) (6
 53) + TX、プロクロノール (1350) + TX、プロフェノホス (662) + TX、 50

プロマシル(1354)+TX、プロパルギット(671)+TX、プロペタムホス(673)+TX、プロボキスル(678)+TX、プロチダチオン(1360)+TX、プロトエート(1362)+TX、ピレトリンI(696)+TX、ピレトリンII(696)+TX、ピレトリン(696)+TX、ピリダベン(699)+TX、ピリダフェンチオン(701)+TX、ピリミジフェン(706)+TX、ピリミテート(1370)+TX、キナルホス(711)+TX、キンチオホス(1381)+TX、R-1492(開発コード)(1382)+TX、RA-17(開発コード)(1383)+TX、ロテノン(722)+TX、シュラダン(1389)+TX、セブホス(代替名)+TX、セラメクチン(代替名)[CCN]+TX、SI-0009(化合物コード)+TX、ソファミド(1402)+TX、スピロジクロフェン(738)+TX、スピロメシフェン(739)+TX、SSI-121(開発コード)(1404)+TX、スルフィラム(代替名)[CCN]+TX、スルフラミド(750)+TX、スルホテブ(753)+TX、硫黄(754)+TX、SZI-121(開発コード)(757)+TX、-フルバリネート(398)+TX、テブフェンピラド(763)+TX、TEPP(1417)+TX、テルバム(代替名)+TX、テトラクロルピンホス(777)+TX、テトラジホン(786)+TX、テトラナクチン(代替名)(653)+TX、テトラスル(1425)+TX、チアフエノクス(代替名)+TX、チオカルボキシム(1431)+TX、チオフアノックス(800)+TX、チオメトン(801)+TX、チオキノックス(1436)+TX、ツリングエンシン(代替名)[CCN]+TX、トリアミホス(1441)+TX、トリアラテン(1443)+TX、トリアゾホス(820)+TX、トリアズロン(代替名)+TX、トリクロルホン(824)+TX、トリフェノホス(1455)+TX、トリナクチン(代替名)(653)+TX、バミドチオン(847)+TX、パニリプロール[CCN]およびYI-5302(化合物コード)+TXからなる物質群から選択される殺ダニ剤、

10

20

ベトキサジン[CCN]+TX、ニオクタノン酸銅(IUPAC名)(170)+TX、硫酸銅(172)+TX、シプトリン[CCN]+TX、ジクロン(1052)+TX、ジクロロフェン(232)+TX、エンドタール(295)+TX、フェンチン(347)+TX、消石灰[CCN]+TX、ナーバム(566)+TX、キノクラミン(714)+TX、キノンアミド(1379)+TX、シマジン(730)+TX、酢酸トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)および水酸化トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)+TXから構成される物質群から選択される殺藻剤、

30

アバメクチン(1)+TX、クルホメート(1011)+TX、ドラメクチン(代替名)[CCN]+TX、エマメクチン(291)+TX、エマメクチン安息香酸塩(291)+TX、エピリノメクチン(代替名)[CCN]+TX、イベルメクチン(代替名)[CCN]+TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN]+TX、モキシデクチン(代替名)[CCN]+TX、ピペラジン[CCN]+TX、セラメクチン(代替名)[CCN]+TX、スピノサド(737)およびチオフアネート(1435)+TXから構成される物質群から選択される駆虫薬、

クロラロース(127)+TX、エンドリン(1122)+TX、フェンチオン(346)+TX、ピリジン-4-アミン(IUPAC名)(23)およびストリキニン(745)+TXから構成される物質群から選択される殺鳥剤、

40

1-ヒドロキシ-1H-ピリジン-2-チオン(IUPAC名)(1222)+TX、4-(キノキサリン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド(IUPAC名)(748)+TX、8-硫酸ヒドロキシキノリン(446)+TX、プロノポール(97)+TX、ニオクタノン酸銅(IUPAC名)(170)+TX、水酸化銅(IUPAC名)(169)+TX、クレゾール[CCN]+TX、ジクロロフェン(232)+TX、ジピリチオン(1105)+TX、ドジチン(1112)+TX、フェナミノスルフ(1144)+TX、ホルムアルデヒド(404)+TX、ヒドラルガフェン(代替名)[CCN]+TX、カスガマイシン(483)+TX、カスガマイシンヒドロクロリド水和物(483)+TX、ニッケルビス(ジメチルジチオカルバメート)(IUPAC名)(130

50

8) + TX、ニトラピリン (580) + TX、オクチリノン (590) + TX、オキシリン酸 (606) + TX、オキシテトラサイクリン (611) + TX、硫酸ヒドロキシキノリンカリウム (446) + TX、プロベナゾール (658) + TX、ストレプトマイシン (744) + TX、ストレプトマイシンセスキルスフェート (744) + TX、テクロフトラム (766) + TX、およびチオメルサル (代替名) [CCN] + TX から構成される物質群から選択される殺菌剤、

リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*) GV (代替名) (12) + TX、アグロバクテリウムラジオバクター (*Agrobacterium radiobacter*) (代替名) (13) + TX、アムプリセイウス属の一種 (*Amblyseius spp.*) (代替名) (19) + TX、アナグラファファルシフェラ (*Anagrapha falcifera*) NPV (代替名) (28) + TX、アングルスマトムス (*Anagrus atomus*) (代替名) (29) + TX、アブラコバチ (*Aphelinus abdominalis*) (代替名) (33) + TX、コレマンアブラバチ (*Aphidius colemani*) (代替名) (34) + TX、ショクガタマバエ (*Aphidoletes aphidimyza*) (代替名) (35) + TX、オートグラファカリホルニカ (*Autographa californica* NPV) (代替名) (38) + TX、バシラスフィルムス (*Bacillus firmus*) (代替名) (48) + TX、バシラススファエリクス (*Bacillus sphaericus* Neide) (学名) (49) + TX、バチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis* Berliner) (学名) (51) + TX、
 バチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *hurstaki*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*) (学名) (51) + TX、ベアウベリアバッシアナ (*Beauveria bassiana*) (代替名) (53) + TX、ベアウベリアブロングニアルチイ (*Beauveria brongniartii*) (代替名) (54) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (代替名) (151) + TX、ツマアカオオヒメテントウ (*Cryptolaemus montrouzieri*) (代替名) (178) + TX、コドリング (*Cydia pomonella*) GV (代替名) (191) + TX、ハモグリコマコバチ (*Dacnusa sibirica*) (代替名) (212) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (代替名) (254) + TX、オンシツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (学名) (293) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (代替名) (300) + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) NPV (代替名) (431) + TX、ヘテロルハブジチスバクテリオホラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) および H. メギジス (*H. megidis*) (代替名) (433) + TX、ヒポダミアコンベルゲンス (*Hippodamia convergens*) (代替名) (442) + TX、フジコナヒゲナガトビコバチ (*Leptomastix dactylopii*) (代替名) (488) + TX、マクロロフスカリジノサス (*Macrolophus caliginosus*) (代替名) (491) + TX、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*) NPV (代替名) (494) + TX、メタフィクスヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) (代替名) (522) + TX、メタリジウムアニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) (学名) (523) + TX、メタリジウムアニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) (学名

10

20

30

40

50

) (523) + TX、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer* NPV) および N. レコンテイ (*N. lecontei* NPV) (代替名) (575) + TX、ヒメハナカメムシ属の一種 (*Orius* spp.) (代替名) (596) + TX、パエシロマイセスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (代替名) (613) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (代替名) (644) + TX、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) マルチカブシド核多角体ウイルス (学名) (741) + TX、ステイネルネマビビオニス (*Steinernema bibionis*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマカルポカプサエ (*Steinernema carpocapsae*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマフェルチアエ (*Steinernema feltiae*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマグラセリ (*Steinernema glaseri*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマリオブラエ b (*Steinernema riobrave*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマリオブラビス (*Steinernema riobravise*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマスカプテリスキ (*Steinernema scapteriscii*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマ属の一種 (*Steinernema* spp.) (代替名) (742) + TX、トリコグラマ属の一種 (*Trichogramma* spp.) (代替名) (826) + TX、チフロドロムスオクシデンタリス (*Typhlodromus occidentalis*) (代替名) (844) およびベルチシリウムレカニイ (*Verticillium lecanii*) (代替名) (848) + TX、バチルスサブチリス var. アミロリクエファシエンス (*Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens*) 菌株 FZB24 (*Novozymes Biologicals Inc.* (5400 Corporate Circle, Salem, VA 24153, U.S.A.) から入手可能であり、および、商品名 Taegro (登録商標) で公知である) + TX から構成される物質群から選択される生物剤、

10

20

ヨードメタン (IUPAC 名) (542) および臭化メチル (537) + TX から構成される物質群から選択される土壌不毛剤、

アホレート [CCN] + TX、ピサジル (代替名) [CCN] + TX、ブスルファン (代替名) [CCN] + TX、ジフルベンズロン (250) + TX、ジマチフ (代替名) [CCN] + TX、ヘメル [CCN] + TX、ヘムバ [CCN] + TX、メテバ [CCN] + TX、メチオテパ [CCN] + TX、メチルアホレート [CCN] + TX、モルジド [CCN] + TX、ペンフルロン (代替名) [CCN] + TX、テバ [CCN] + TX、チオヘムバ (代替名) [CCN] + TX、チオテパ (代替名) [CCN] + TX、トレタミン (代替名) [CCN] およびウレデパ (代替名) [CCN] + TX から構成される物質群から選択される不妊化剤、

30

(E) - デカ - 5 - エン - 1 - イルアセテートを伴う (E) - デカ - 5 - エン - 1 - オール (IUPAC 名) (222) + TX、(E) - トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (829) + TX、(E) - 6 - メチルヘプタ - 2 - エン - 4 - オール (IUPAC 名) (541) + TX、(E, Z) - テトラデカ - 4, 10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (779) + TX、(Z) - ドデカ - 7 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (285) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エナール (IUPAC 名) (436) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (437) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 13 - エン - 11 - イン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (438) + TX、(Z) - イコス - 13 - エン - 10 - オン (IUPAC 名) (448) + TX、(Z) - テトラデカ - 7 - エン - 1 - アル (IUPAC 名) (782) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - オール (IUPAC 名) (783) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (784) + TX、(7E, 9Z) - ドデカ - 7, 9 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (283) + TX、(9Z, 11E) - テトラデカ - 9

40

50

, 11 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (780) + TX、(9Z, 12E) - テトラデカ - 9, 12 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (781) + TX、14 - メチルオクタデカ - 1 - エン (IUPAC名) (545) + TX、4 - メチルノナン - 5 - オールを伴う 4 - メチルノナン - 5 - オン (IUPAC名) (544) + TX、 - ムルチストリアチン (代替名) [CCN] + TX、プレビコミン (代替名) [CCN] + TX、コドレルレ (代替名) [CCN] + TX、コドレモン (代替名) (167) + TX、クエルレ (代替名) (179) + TX、ジスパールア (277) + TX、ドデカ - 8 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (286) + TX、ドデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (287) + TX、ドデカ - 8 + TX、10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (284) + TX、ドミニカルア (代替名) [CCN] + TX、エチル 4 - メチルオクタノエート (IUPAC名) (317) + TX、オイゲノール (代替名) [CCN] + TX、フロントリン (代替名) [CCN] + TX、ゴシッブルア (代替名) (420) + TX、グランドルア (421) + TX、グランドルア I (代替名) (421) + TX、グランドルア II (代替名) (421) + TX、グランドルア III (代替名) (421) + TX、グランドルア IV (代替名) (421) + TX、ヘキサルア [CCN] + TX、イブスジエノール (代替名) [CCN] + TX、イブセノール (代替名) [CCN] + TX、ジャボニルア (代替名) (481) + TX、リネアチン (代替名) [CCN] + TX、リトルア (代替名) [CCN] + TX、ルーブルア (代替名) [CCN] + TX、メドルア [CCN] + TX、メガトモ酸 (代替名) [CCN] + TX、メチルオイゲノール (代替名) (540) + TX、ムスカルア (563) + TX、オクタデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (588) + TX、オクタデカ - 3, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (589) + TX、オルラルア (代替名) [CCN] + TX、オリクトルア (代替名) (317) + TX、オストラモン (代替名) [CCN] + TX、シグルア [CCN] + TX、ソルジジン (代替名) (736) + TX、スルカトール (代替名) [CCN] + TX、テトラデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (785) + TX、トリメドルア (839) + TX、トリメドルア A (代替名) (839) + TX、トリメドルア B 1 (代替名) (839) + TX、トリメドルア B 2 (代替名) (839) + TX、トリメドルア C (代替名) (839) およびトランクコール (代替名) [CCN] + TX から構成される物質群から選択される昆虫フェロモン、

2 - (オクチルチオ) - エタノール (IUPAC名) (591) + TX、プトピロノキシル (933) + TX、プトキシ (ポリプロピレングリコール) (936) + TX、ジブチルアジベート (IUPAC名) (1046) + TX、フタル酸ジブチル (1047) + TX、ジブチルコハク酸塩 (IUPAC名) (1048) + TX、ジエチルトルアミド [CCN] + TX、ジメチルカルベート [CCN] + TX、ジメチルフタレート [CCN] + TX、エチルヘキサンジオール (1137) + TX、ヘキサミド [CCN] + TX、メトキンブチル (1276) + TX、メチルネオデカンアミド [CCN] + TX、オキサメート [CCN] およびピカリジン [CCN] + TX から構成される物質群から選択される昆虫忌避剤、

1 - ジクロロ - 1 - ニトロエタン (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (1058) + TX、1, 1 - ジクロロ - 2, 2 - ビス (4 - エチルフェニル) エタン (IUPAC名) (1056)、+ TX、1, 2 - ジクロロプロパン (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (1062) + TX、1, 3 - ジクロロプロパンを伴う 1, 2 - ジクロロプロパン (IUPAC名) (1063) + TX、1 - プロモ - 2 - クロロエタン (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (916) + TX、2, 2, 2 - トリクロロ - 1 - (3, 4 - ジクロロフェニル) 酢酸エチル (IUPAC名) (1451) + TX、2, 2 - ジクロロビニル 2 - エチルスルフィニルエチルメチルリン酸 (IUPAC名) (1066) + TX、2 - (1, 3 - ジチオラン - 2 - イル) フェニルジメチルカルバメート (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (1109) + TX、2 - (2 - プトキシエトキシ) エチルチオシアネート (I

U P A C / C h e m i c a l A b s t r a c t s 名) (9 3 5) + T X、 2 - (4 , 5
 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イル) フェニルメチルカルバメート (I U P A
 C / C h e m i c a l A b s t r a c t s 名) (1 0 8 4) + T X、 2 - (4 - クロロ
 - 3 , 5 - キシリルオキシ) エタノール (I U P A C 名) (9 8 6) + T X、 2 - クロロ
 ビニルジエチルリン酸 (I U P A C 名) (9 8 4) + T X、 2 - イミダゾリドン (I U P
 A C 名) (1 2 2 5) + T X、 2 - イソバレリルインダン - 1 , 3 - ジオン (I U P A C
 名) (1 2 4 6) + T X、 2 - メチル (プロブ - 2 - イニル) アミノフェニルメチルカル
 バメート (I U P A C 名) (1 2 8 4) + T X、 2 - チオシアナトエチルラウレート (I
 U P A C 名) (1 4 3 3) + T X、 3 - プロモ - 1 - クロロプロブ - 1 - エン (I U P A
 C 名) (9 1 7) + T X、 3 - メチル - 1 - フェニルピラゾール - 5 - イルジメチルカル
 バメート (I U P A C 名) (1 2 8 3) + T X、 4 - メチル (プロブ - 2 - イニル) アミ
 ノ - 3 , 5 - キシリルメチルカルバメート (I U P A C 名) (1 2 8 5) + T X、 5 , 5
 - ジメチル - 3 - オキソシクロヘキサ - 1 - エニルジメチルカルバメート (I U P A C 名
) (1 0 8 5) + T X、 アバメクチン (1) + T X、 アセフェート (2) + T X、 アセタ
 ミブリド (4) + T X、 アセチオン (代替名) [C C N] + T X、 アセトプロール [C C
 N] + T X、 アクリナトリン (9) + T X、 アクリロニトリル (I U P A C 名) (8 6 1
) + T X、 アラニカルブ (1 5) + T X、 アルジカルブ (1 6) + T X、 アルドキシカル
 ブ (8 6 3) + T X、 アルドリン (8 6 4) + T X、 アレトリン (1 7) + T X、 アロサ
 ミジン (代替名) [C C N] + T X、 アリキシカルブ (8 6 6) + T X、 - シベルメト
 リン (2 0 2) + T X、 - エクジソン (代替名) [C C N] + T X、 リン化マグネシウ
 ム (6 4 0) + T X、 アミジチオン (8 7 0) + T X、 アミドチオエート (8 7 2) + T
 X、 アミノカルブ (8 7 3) + T X、 アミトン (8 7 5) + T X、 シュウ酸水素アミトン
 (8 7 5) + T X、 アミトラズ (2 4) + T X、 アナバシン (8 7 7) + T X、 アチダチ
 オン (8 8 3) + T X、 A V I 3 8 2 (化合物コード) + T X、 A Z 6 0 5 4 1 (化合物
 コード) + T X、 アザジラクチン (代替名) (4 1) + T X、 アザメチホス (4 2) + T
 X、 アジンホス - エチル (4 4) + T X、 アジンホス - メチル (4 5) + T X、 アゾトエ
 ート (8 8 9) + T X、 パチルスチューリングゲンシス (B a c i l l u s t h u r i n
 g i e n s i s) エンドトキシ (代替名) (5 2) + T X、 バリウムヘキサフルオロ
 シリケート (代替名) [C C N] + T X、 バリウムポリスルフィド (I U P A C / C h e
 m i c a l A b s t r a c t s 名) (8 9 2) + T X、 バルトリン [C C N] + T X、
 バイエル 2 2 / 1 9 0 (開発コード) (8 9 3) + T X、 バイエル 2 2 4 0 8 (開発コー
 ド) (8 9 4) + T X、 ベンジオカルブ (5 8) + T X、 ベンフラカルブ (6 0) + T X
 、 ベンサルタップ (6 6) + T X、 - シフルトリン (1 9 4) + T X、 - シベルメト
 リン (2 0 3) + T X、 ビフェントリン (7 6) + T X、 ビオアレトリン (7 8) + T X
 、 ビオアレトリン S - シクロペンテニル異性体 (代替名) (7 9) + T X、 バイオエタノ
 メトリン [C C N] + T X、 ビオパーメトリン (9 0 8) + T X、 ビオレスメトリン (8
 0) + T X、 ビス (2 - クロロエチル) エーテル (I U P A C 名) (9 0 9) + T X、 ビ
 ストリフルロン (8 3) + T X、 ホウ酸ナトリウム (8 6) + T X、 プロフェンバレレ
 ート (代替名) + T X、 プロムフェンピンホス (9 1 4) + T X、 プロモシクレン (9 1 8
) + T X、 プロモ - D D T (代替名) [C C N] + T X、 プロモホス (9 2 0) + T X、
 プロモホス - エチル (9 2 1) + T X、 プフェンカルブ (9 2 4) + T X、 ププロフェジ
 ン (9 9) + T X、 プタカルブ (9 2 6) + T X、 プタチオホス (9 2 7) + T X、 プト
 カルボキシム (1 0 3) + T X、 プトネート (9 3 2) + T X、 プトキシカルボキシム (1
 0 4) + T X、 プチルピリダベン (代替名) + T X、 カズサホス (1 0 9) + T X、 ヒ
 酸カルシウム [C C N] + T X、 シアン化カルシウム (4 4 4) + T X、 多硫酸カルシウ
 ム (I U P A C 名) (1 1 1) + T X、 カンフェクロール (9 4 1) + T X、 カルバノレ
 ート (9 4 3) + T X、 カルバリル (1 1 5) + T X、 カルボフラン (1 1 8) + T X、
 二硫化炭素 (I U P A C / C h e m i c a l A b s t r a c t s 名) (9 4 5) + T X
 、 四塩化炭素 (I U P A C 名) (9 4 6) + T X、 カルボフェノチオン (9 4 7) + T X
 、 カルボスルファン (1 1 9) + T X、 カルタップ (1 2 3) + T X、 カルタップヒドロ

10

20

30

40

50

クロリド (1 2 3) + T X、セバジン (代替名) (7 2 5) + T X、クロルビシクレン (9 6 0) + T X、クロルダン (1 2 8) + T X、クロルデコン (9 6 3) + T X、クロルジメホルム (9 6 4) + T X、クロルジメホルムヒドロクロリド (9 6 4) + T X、クロルエトキシホス (1 2 9) + T X、クロルフエナピル (1 3 0) + T X、クロルフエンピホス (1 3 1) + T X、クロルフルアズロン (1 3 2) + T X、クロルメホス (1 3 6) + T X、クロホルム [C C N] + T X、クロルピクリン (1 4 1) + T X、クロルホキシム (9 8 9) + T X、クロルブラゾホス (9 9 0) + T X、クロルピリホス (1 4 5) + T X、クロルピリホス - メチル (1 4 6) + T X、クロルチオホス (9 9 4) + T X、クロマフェノジド (1 5 0) + T X、シネリン I (6 9 6) + T X、シネリン I I (6 9 6) + T X、シネリンス (6 9 6) + T X、c i s - レスメスリン (代替名) + T X、シスメトリン (8 0) + T X、クロシトリン (代替名) + T X、クロエトカルブ (9 9 9) + T X、クロサンテル (代替名) [C C N] + T X、クロチアニジン (1 6 5) + T X、アセト亜ヒ酸銅 [C C N] + T X、ヒ酸銅 [C C N] + T X、オレイン酸銅 [C C N] + T X、クマホス (1 7 4) + T X、クミトエート (1 0 0 6) + T X、クロタミトン (代替名) [C C N] + T X、クロトキシホス (1 0 1 0) + T X、クルホメート (1 0 1 1) + T X、氷晶石 (代替名) (1 7 7) + T X、C S 7 0 8 (開発コード) (1 0 1 2) + T X、シアノフェンホス (1 0 1 9) + T X、シアノホス (1 8 4) + T X、シアントエート (1 0 2 0) + T X、シクレトリン [C C N] + T X、シクロプロトリン (1 8 8) + T X、シフルトリン (1 9 3) + T X、シハロトリン (1 9 6) + T X、シベルメトリン (2 0 1) + T X、シフェノトリン (2 0 6) + T X、シロマジン (2 0 9) + T X、シチオエート (代替名) [C C N] + T X、d - リモネン (代替名) [C C N] + T X、d - テトラメトリン (代替名) (7 8 8) + T X、D A E P (1 0 3 1) + T X、ダゾメット (2 1 6) + T X、D D T (2 1 9) + T X、デカルボフラン (1 0 3 4) + T X、デルタメトリン (2 2 3) + T X、デメフィオン (1 0 3 7) + T X、デメフィオン - O (1 0 3 7) + T X、デメフィオン - S (1 0 3 7) + T X、デメトン (1 0 3 8) + T X、デメトン - メチル (2 2 4) + T X、デメトン - O (1 0 3 8) + T X、デメトン - O - メチル (2 2 4) + T X、デメトン - S (1 0 3 8) + T X、デメトン - S - メチル (2 2 4) + T X、デメトン - S - メチルスルホン (1 0 3 9) + T X、ジアフェンチウロン (2 2 6) + T X、ジアリホス (1 0 4 2) + T X、ジアミダホス (1 0 4 4) + T X、ダイアジノン (2 2 7) + T X、ジカプトン (1 0 5 0) + T X、ジクロロフェンチオン (1 0 5 1) + T X、ジクロルボス (2 3 6) + T X、ジクリホス (代替名) + T X、ジクレシル (代替名) [C C N] + T X、ジクロトホス (2 4 3) + T X、ジシクラニル (2 4 4) + T X、ディルドリン (1 0 7 0) + T X、ジエチル 5 - メチルピラゾール - 3 - イルリン酸塩 (I U P A C 名) (1 0 7 6) + T X、ジフルベンズロン (2 5 0) + T X、ジロール (代替名) [C C N] + T X、ジメフルトリン [C C N] + T X、ジメホクス (1 0 8 1) + T X、ジメタン (1 0 8 5) + T X、ジメトエート (2 6 2) + T X、ジメトリン (1 0 8 3) + T X、ジメチルピンホス (2 6 5) + T X、ジメチラン (1 0 8 6) + T X、ジネクス (1 0 8 9) + T X、ジネクスジクレキシシ (1 0 8 9) + T X、ジノプロブ (1 0 9 3) + T X、ジノサム (1 0 9 4) + T X、ジノセブ (1 0 9 5) + T X、ジノテフラン (2 7 1) + T X、ジオフェノラン (1 0 9 9) + T X、ジオキサベンゾホス (1 1 0 0) + T X、ジオキサカルブ (1 1 0 1) + T X、ジオキサチオン (1 1 0 2) + T X、ジスルホトン (2 7 8) + T X、ジチクロホス (1 1 0 8) + T X、D N O C (2 8 2) + T X、ドラメクチン (代替名) [C C N] + T X、D S P (1 1 1 5) + T X、エクジステロン (代替名) [C C N] + T X、E I 1 6 4 2 (開発コード) (1 1 1 8) + T X、エマメクチン (2 9 1) + T X、エマメクチン安息香酸塩 (2 9 1) + T X、E M P C (1 1 2 0) + T X、エムペントリン (2 9 2) + T X、エンドスルファン (2 9 4) + T X、エンドチオン (1 1 2 1) + T X、エンドリン (1 1 2 2) + T X、E P B P (1 1 2 3) + T X、E P N (2 9 7) + T X、エポフェノナン (1 1 2 4) + T X、エピリノメクチン (代替名) [C C N] + T X、エスフェンバレレート (3 0 2) + T X、エタホス (代替名) [C C N] + T X、エチオフエンカルブ (3

10

20

30

40

50

08) + TX、エチオン(309) + TX、エチプロール(310) + TX、エトエート
 メチル(1134) + TX、エトプロホス(312) + TX、ギ酸エチル(IUPAC名
) [CCN] + TX、エチル-DDD(代替名)(1056) + TX、エチレンジプロミ
 ド(316) + TX、ジクロロエタン(化学名)(1136) + TX、エチレンオキシド
 [CCN] + TX、エトフェンブックス(319) + TX、エトリムホス(1142)
 + TX、EXD(1143) + TX、ファンファー(323) + TX、フェナミホス(3
 26) + TX、フェナザフロル(1147) + TX、フェンクロルホス(1148) + T
 X、フェネタカルブ(1149) + TX、フェンフルトリン(1150) + TX、フェニ
 トロチオン(335) + TX、フェノブカルブ(336) + TX、フェノキサクリム(1
 153) + TX、フェノキシカルブ(340) + TX、フェンピリトリン(1155) +
 TX、フェンプロパトリン(342) + TX、フェンピラド(代替名) + TX、フェンス
 ルホチオン(1158) + TX、フェンチオン(346) + TX、フェンチオン-エチル
 [CCN] + TX、フェンバレレート(349) + TX、フィプロニル(354) + TX
 、フロニカミド(358) + TX、フルベンジアミド(CAS登録番号:272451-
 65-7) + TX、フルコフロン(1168) + TX、フルシクロクスロン(366) +
 TX、フルシトリネート(367) + TX、フルエネチル(1169) + TX、フルフェ
 ネリム[CCN] + TX、フルフェノクスロン(370) + TX、フルフェンブックス
 (
 1171) + TX、フルメトリン(372) + TX、フルバリネート(1184) + TX
 、FMC1137(開発コード)(1185) + TX、フォノホス(1191) + TX、
 ホルメタネート(405) + TX、ホルメタネートヒドロクロリド(405) + TX、ホル
 モチオン(1192) + TX、ホルムパラネート(1193) + TX、ホスメチラン(
 1194) + TX、ホスピレート(1195) + TX、ホスチアゼート(408) + TX
 、ホスチエタン(1196) + TX、フラチオカルブ(412) + TX、フレトリン(1
 200) + TX、
 -シハロトリン(197) + TX、
 -HCH(430) + TX、グ
 アザチン(422) + TX、グアザチン酢酸塩(422) + TX、GY-81(開発コー
 ド)(423) + TX、ハルフェンブックス(424) + TX、ハロフェノジド(425
) + TX、HCH(430) + TX、HEOD(1070) + TX、ヘプタクロル(12
 11) + TX、ヘプテノホス(432) + TX、ヘテロホス[CCN] + TX、ヘキサフ
 ルムロン(439) + TX、HHDN(864) + TX、ヒドラメチルノン(443) +
 TX、シアン化水素(444) + TX、ヒドロブレン(445) + TX、ヒキンカルブ(
 1223) + TX、イミダクロプリド(458) + TX、イミプロトリン(460) + T
 X、インドキサカルブ(465) + TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542) + T
 X、IPSP(1229) + TX、イサゾホス(1231) + TX、イソベンザン(12
 32) + TX、イソカルボホス(代替名)(473) + TX、イソドリン(1235) +
 TX、イソフェンホス(1236) + TX、イソラン(1237) + TX、イソプロカル
 ブ(472) + TX、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
 (IUPAC名)(473) + TX、イソプロチオラン(474) + TX、イソチオエー
 ト(1244) + TX、イソキサチオン(480) + TX、イベルメクチン(代替名)[
 CCN] + TX、ジャスモリンI(696) + TX、ジャスモリンII(696) + TX
 、ジヨドフェンホス(1248) + TX、幼虫ホルモンI(代替名)[CCN] + TX、
 幼虫ホルモンII(代替名)[CCN] + TX、幼虫ホルモンIII(代替名)[CCN
] + TX、ケレバン(1249) + TX、キノブレン(484) + TX、ラムダ-シハロ
 トリン(198) + TX、硫酸鉛[CCN] + TX、レピメクチン(CCN) + TX、レ
 プトホス(1250) + TX、リンダン(430) + TX、リリムホス(1251) + T
 X、ルフェヌロン(490) + TX、リチダチオン(1253) + TX、m-クメニルメ
 チルカルバメート(IUPAC名)(1014) + TX、リン化マグネシウム(IUPA
 C名)(640) + TX、マラチオン(492) + TX、マロノベン(1254) + TX
 、マジドクス(1255) + TX、メカルバム(502) + TX、メカルホン(1258
) + TX、メナゾン(1260) + TX、メホスフォラン(1261) + TX、塩化第一

10

20

30

40

50

水銀 (5 1 3) + T X、メスルフェンホス (1 2 6 3) + T X、メタフルミゾン (C C N) + T X、メタム (5 1 9) + T X、メタム - カリウム (代替名) (5 1 9) + T X、メタム - ナトリウム (5 1 9) + T X、メタクリホス (1 2 6 6) + T X、メタミドホス (5 2 7) + T X、フッ化メタンスルホニル (I U P A C / C h e m i c a l A b s t r a c t s 名) (1 2 6 8) + T X、メチダチオン (5 2 9) + T X、メチオカルブ (5 3 0) + T X、メトクロトホス (1 2 7 3) + T X、メソミル (5 3 1) + T X、メトブレ
 ン (5 3 2) + T X、メトキンブチル (1 2 7 6) + T X、メトトリン (代替名) (5 3 3) + T X、メトキシクロル (5 3 4) + T X、メトキシフェノジド (5 3 5) + T X、
 臭化メチル (5 3 7) + T X、メチルイソチオシアネート (5 4 3) + T X、メチルクロ
 ロホルム (代替名) [C C N] + T X、塩化メチレン [C C N] + T X、メトフルトリン 10
 [C C N] + T X、メトルカルブ (5 5 0) + T X、メトキサジアゾン (1 2 8 8) + T X、
 メビンホス (5 5 6) + T X、メキサカルベート (1 2 9 0) + T X、ミルベメクチ
 ン (5 5 7) + T X、ミルマイシンオキシム (代替名) [C C N] + T X、ミパホクス
 (1 2 9 3) + T X、ミレックス (1 2 9 4) + T X、モノクロトホス (5 6 1) + T X
 、モルホチオン (1 3 0 0) + T X、モキシデクチン (代替名) [C C N] + T X、ナフ
 タロホス (代替名) [C C N] + T X、ナレド (5 6 7) + T X、ナフタレン (I U P A
 C / C h e m i c a l A b s t r a c t s 名) (1 3 0 3) + T X、NC - 1 7 0 (開
 発コード) (1 3 0 6) + T X、NC - 1 8 4 (化合物コード) + T X、ニコチン (5 7
 8) + T X、ニコチンスルフェート (5 7 8) + T X、ニフルリジド (1 3 0 9) + T X
 、ニテンピラム (5 7 9) + T X、ニチアジン (1 3 1 1) + T X、ニトリラカルブ (1
 3 1 3) + T X、ニトリラカルブ 1 : 1 塩化亜鉛錯体 (1 3 1 3) + T X、NNI - 0 1
 0 1 (化合物コード) + T X、NNI - 0 2 5 0 (化合物コード) + T X、ノルニコチン
 (慣習名) (1 3 1 9) + T X、ノバルロン (5 8 5) + T X、ノビフルムロン (5 8 6
) + T X、O - 5 - ジクロロ - 4 - ヨードフェニル O - エチルエチルホスホノチオエート
 (I U P A C 名) (1 0 5 7) + T X、O , O - ジエチル O - 4 - メチル - 2 - オキソ -
 2 H - クロメン - 7 - イルホスホロチオネート (I U P A C 名) (1 0 7 4) + T X、O
 , O - ジエチル O - 6 - メチル - 2 - プロピルピリミジン - 4 - イルホスホロチオネート
 (I U P A C 名) (1 0 7 5) + T X、O , O , O ' , O ' - テトラプロピルジチオピロ
 ホスフェート (I U P A C 名) (1 4 2 4) + T X、オレイン酸 (I U P A C 名) (5 9
 3) + T X、オメトエート (5 9 4) + T X、オキサミル (6 0 2) + T X、オキシデメ
 トン - メチル (6 0 9) + T X、オキシデプロホス (1 3 2 4) + T X、オキシジスルホ
 トン (1 3 2 5) + T X、pp ' - DDT (2 1 9) + T X、パラ - ジクロロベンゼン [C C N] + T X、
 パラチオン (6 1 5) + T X、パラチオン - メチル (6 1 6) + T X、
 ペンフルロン (代替名) [C C N] + T X、ペンタクロロフェノール (6 2 3) + T X、
 ラウリン酸ペンタクロロフェニル (I U P A C 名) (6 2 3) + T X、ペルメトリン (6
 2 6) + T X、石油 (代替名) (6 2 8) + T X、PH 6 0 - 3 8 (開発コード) (1 3
 2 8) + T X、フェンカプトン (1 3 3 0) + T X、フェノトリン (6 3 0) + T X、フ
 ェントエート (6 3 1) + T X、ホレート (6 3 6) + T X、ホサロン (6 3 7) + T X
 、ホスホラン (1 3 3 8) + T X、ホスメット (6 3 8) + T X、ホスニクロル (1 3 3
 9) + T X、ホスファミドン (6 3 9) + T X、ホスフィン (I U P A C 名) (6 4 0)
 + T X、ホキシム (6 4 2) + T X、ホキシム - メチル (1 3 4 0) + T X、ピリメタホ
 ス (1 3 4 4) + T X、ピリミカーブ (6 5 1) + T X、ピリミホス - エチル (1 3 4 5
) + T X、ピリミホス - メチル (6 5 2) + T X、ポリクロロジシクロペンタジエン異性
 体 (I U P A C 名) (1 3 4 6) + T X、ポリクロロテルペン (慣習名) (1 3 4 7) +
 T X、亜ヒ酸カリウム [C C N] + T X、カリウムチオシアネート [C C N] + T X、プ
 ラレトリン (6 5 5) + T X、プレコセン I (代替名) [C C N] + T X、プレコセン I
 I (代替名) [C C N] + T X、プレコセン I I I (代替名) [C C N] + T X、プリミ
 ドホス (1 3 4 9) + T X、プロフェノホス (6 6 2) + T X、プロフルトリン [C C N
] + T X、プロマシル (1 3 5 4) + T X、プロメカルブ (1 3 5 5) + T X、プロパホ
 ス (1 3 5 6) + T X、プロベタムホス (6 7 3) + T X、プロボキスル (6 7 8) + T 40
 50

X、プロチダチオン(1360)+TX、プロチオホス(686)+TX、プロトエート(1362)+TX、プロトリフェンブト[CCN]+TX、ピメトロジン(688)+TX、ピラクロホス(689)+TX、ピラゾホス(693)+TX、ピレスメトリン(1367)+TX、ピレトリンI(696)+TX、ピレトリンII(696)+TX、ピレトリン(696)+TX、ピリダベン(699)+TX、ピリダリル(700)+TX、ピリダフェンチオン(701)+TX、ピリミジフェン(706)+TX、ピリミテート(1370)+TX、ピリプロキシフェン(708)+TX、カシヤ(代替名)[CCN]+TX、キナルホス(711)+TX、キナルホス-メチル(1376)+TX、キノチオン(1380)+TX、キンチオホス(1381)+TX、R-1492(開発コード)(1382)+TX、ラホキサニド(代替名)[CCN]+TX、レスメスリン(719)+TX、ロテノン(722)+TX、RU15525(開発コード)(723)+TX、RU25475(開発コード)(1386)+TX、リアニア(代替名)(1387)+TX、リアノジン(慣習名)(1387)+TX、サバジラ(代替名)(725)+TX、シュラダン(1389)+TX、セブホス(代替名)+TX、セラメクチン(代替名)[CCN]+TX、SI-0009(化合物コード)+TX、SI-0205(化合物コード)+TX、SI-0404(化合物コード)+TX、SI-0405(化合物コード)+TX、シラフルオフエン(728)+TX、SN72129(開発コード)(1397)+TX、亜ヒ酸ナトリウム[CCN]+TX、シアン化ナトリウム(444)+TX、ナトリウムフッ化物(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1399)+TX、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム(1400)+TX、ペンタクロロフェノキシドナトリウム塩(623)+TX、セレン酸ナトリウム(IUPAC名)(1401)+TX、チオシアン酸ナトリウム[CCN]+TX、ソファミド(1402)+TX、スピノサド(737)+TX、スピロメシフェン(739)+TX、スピロテトラマト(CCN)+TX、スルコフロソ(746)+TX、スルコフロソ-ナトリウム(746)+TX、スルフラミド(750)+TX、スルホテブ(753)+TX、スルフルルフッ化物(756)+TX、スルプロホス(1408)+TX、タール油(代替名)(758)+TX、-フルバリネート(398)+TX、チオナジン(1412)+TX、TDE(1414)+TX、テブフェノジド(762)+TX、テブフェンピラド(763)+TX、テブピリムホス(764)+TX、テフルベンズロン(768)+TX、テフルトリソ(769)+TX、テムホス(770)+TX、TEPP(1417)+TX、テラレスリン(1418)+TX、テルバム(代替名)+TX、テルブホス(773)+TX、テトラクロロエタン[CCN]+TX、テトラクロルピンホス(777)+TX、テトラメトリン(787)+TX、-シベルメトリン(204)+TX、チアクロプリド(791)+TX、チアフェノクス(代替名)+TX、チアメトキサム(792)+TX、チクロホス(1428)+TX、チオカルボキシム(1431)+TX、チオシクラム(798)+TX、チオシクラム水素オキサレート(798)+TX、チオジカルブ(799)+TX、チオフアノックス(800)+TX、チオメトソ(801)+TX、チオナジン(1434)+TX、チオスルタップ(803)+TX、チオスルタップ-ナトリウム(803)+TX、ツリングエンシソ(代替名)[CCN]+TX、トルフェンピラド(809)+TX、トラロメトリン(812)+TX、トランスフルトリソ(813)+TX、トランスパーメトリン(1440)+TX、トリアミホス(1441)+TX、トリアザメート(818)+TX、トリアゾホス(820)+TX、トリアズロン(代替名)+TX、トリクロルホン(824)+TX、トリクロルメタホス-3(代替名)[CCN]+TX、トリクロロナト(1452)+TX、トリフェノホス(1455)+TX、トリフルムロン(835)+TX、トリメタカルブ(840)+TX、トリプレソ(1459)+TX、パミドチオン(847)+TX、パニリプロール[CCN]+TX、ベラトリジン(代替名)(725)+TX、ベラトリソ(代替名)(725)+TX、XMC(853)+TX、キシリルカルブ(854)+TX、YI-5302(化合物コード)+TX、-シベルメトリン(205)+TX、メトリン(代替名)+

10

20

30

40

50

TX、亜鉛ホスフィド(640)+TX、ゾラプロホス(1469)およびZXI8901(開発コード)(858)+TX、シアントラニリプロール[736994-63-19]+TX、クロラントラニリプロール[500008-45-7]+TX、シエノピラフェン[560121-52-0]+TX、シフルメトフェン[400882-07-7]+TX、ピリフルキナゾン[337458-27-2]+TX、スピネトラム[187166-40-1+187166-15-0]+TX、スピロテトラマト[203313-25-1]+TX、スルホキサフロル[946578-00-3]+TX、フルフィプロール[704886-18-0]+TX、メペルフルトリン[915288-13-0]+TX、テトラメチルフルトリン[84937-88-2]+TX、トリフルメゾピリン(国際公開第2012/092115号に開示されている)+TXからなる物質群から選択される殺虫剤、

ビス(トリブチルスズ)オキシド(IUPAC名)(913)+TX、プロモアセタミド[CCN]+TX、ヒ酸カルシウム[CCN]+TX、クロエトカルブ(999)+TX、アセト亜ヒ酸銅[CCN]+TX、硫酸銅(172)+TX、フェンチン(347)+TX、第二鉄リン酸(IUPAC名)(352)+TX、メタルデヒド(518)+TX、メチオカルブ(530)+TX、ニクロシアミド(576)+TX、ニクロシアミドオラミン(576)+TX、ペンタクロロフェノール(623)+TX、ペンタクロロフェノキシドナトリウム塩(623)+TX、チオナジン(1412)+TX、チオジカルブ(799)+TX、酸化トリブチルスズ(913)+TX、トリフェンモルフ(1454)+TX、トリメタカルブ(840)+TX、酢酸トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)および水酸化トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)+TX、ピリプロール[394730-71-3]+TXから構成される物質群から選択される殺軟体動物剤、

AKD-3088(化合物コード)+TX、1,2-ジブromo-3-クロロプロパン(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1045)+TX、1,2-ジクロロプロパン(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1062)+TX、1,2-ジクロロプロパンを伴う1,3-ジクロロプロペン(IUPAC名)(1063)+TX、1,3-ジクロロプロペン(233)+TX、3,4-ジクロロテトラヒドロチオフェン1,1-ジオキシド(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1065)+TX、3-(4-クロロフェニル)-5-メチルロダニン(IUPAC名)(980)+TX、5-メチル-6-チオキソ-1,3,5-チアジアジナン-3-イル酢酸(IUPAC名)(1286)+TX、6-イソペンテニルアミノプリン(代替名)(210)+TX、アバメクチン(1)+TX、アセトプロール[CCN]+TX、アラニカルブ(15)+TX、アルジカルブ(16)+TX、アルドキシカルブ(863)+TX、AZ60541(化合物コード)+TX、ベンクロチアズ[CCN]+TX、ベノミル(62)+TX、ブチルピリダベン(代替名)+TX、カズサホス(109)+TX、カルボフラン(118)+TX、二硫化炭素(945)+TX、カルボスルファン(119)+TX、クロルピクリン(141)+TX、クロルピリホス(145)+TX、クロエトカルブ(999)+TX、サイトカイニン(代替名)(210)+TX、ダゾメット(216)+TX、DBC P(1045)+TX、DCIP(218)+TX、ジアミダホス(1044)+TX、ジクロロフェンチオン(1051)+TX、ジクリホス(代替名)+TX、ジメトエート(262)+TX、ドラメクチン(代替名)[CCN]+TX、エマメクチン(291)+TX、エマメクチン安息香酸塩(291)+TX、エピリノメクチン(代替名)[CCN]+TX、エトプロホス(312)+TX、エチレンジブromid(316)+TX、フェナミホス(326)+TX、フェンピラド(代替名)+TX、フェンスルホチオン(1158)+TX、ホスチアゼート(408)+TX、ホスチエタン(1196)+TX、ルフラール(代替名)[CCN]+TX、GY-81(開発コード)(423)+TX、ヘテロホス[CCN]+TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542)+TX、イサミドホス(1230)+TX、イサゾホス(1231)+TX、イベルメクチン(代替名)[CCN]+TX、カイネチン(代替名)(

10

20

30

40

50

210) + TX、メカルホン(1258) + TX、メタム(519) + TX、メタムカリウム(代替名)(519) + TX、メタムナトリウム(519) + TX、臭化メチル(537) + TX、メチルイソチオシアネート(543) + TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN] + TX、モキシデクチン(代替名)[CCN] + TX、ミロテシウムベルカリア(*Myrothecium verrucaria*)組成物(代替名)(565) + TX、NC-184(化合物コード) + TX、オキサミル(602) + TX、ホレート(636) + TX、ホスファミドン(639) + TX、ホスホカルブ[CCN] + TX、セブホス(代替名) + TX、セラメクチン(代替名)[CCN] + TX、スピノサド(737) + TX、テルバム(代替名) + TX、テルブホス(773) + TX、テトラクロロチオフェン(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1422) + TX、チアフェノクス(代替名) + TX、チオナジン(1434) + TX、トリアゾホス(820) + TX、トリアズロン(代替名) + TX、キシレノルス[CCN] + TX、YI-5302(化合物コード)およびゼアチン(代替名)(210) + TX、フルエンズルホン[318290-98-1] + TXから構成される物質群から選択される殺線虫剤、

エチルキサントゲン酸カリウム[CCN]およびニトラピリン(580) + TXから構成される物質群から選択される硝化抑制剤、

アシベンゾラル(6) + TX、アシベンゾラル-S-メチル(6) + TX、プロベナゾール(658)およびオオイタドリ(*Reynoutria sachalinensis*)抽出物(代替名)(720) + TXから構成される物質群から選択される植物活性化剤、

2-イソバレリルインダン-1,3-ジオン(IUPAC名)(1246) + TX、4-(キノキサリン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド(IUPAC名)(748) + TX、-クロロヒドリン[CCN] + TX、リン化アルミニウム(640) + TX、アンツ(880) + TX、三酸化ヒ素(882) + TX、炭酸バリウム(891) + TX、ビスチオセミ(912) + TX、プロジファクム(89) + TX、プロマジオロン(91) + TX、プロメタリン(92) + TX、シアン化カルシウム(444) + TX、クロラース(127) + TX、クロロファシノン(140) + TX、コレカルシフェロール(代替名)(850) + TX、クマクロル(1004) + TX、クマフリル(1005) + TX、クマテトラリル(175) + TX、クリミジン(1009) + TX、ジフェナクム(246) + TX、ジフェチアロン(249) + TX、ジファシノン(273) + TX、エルゴカルシフェロール(301) + TX、フロクマフェン(357) + TX、フルオロアセタミド(379) + TX、フルプロバジン(1183) + TX、フルプロバジンヒドロクロリド(1183) + TX、-HCH(430) + TX、HCH(430) + TX、シアン化水素(444) + TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542) + TX、リンダン(430) + TX、リン化マグネシウム(IUPAC名)(640) + TX、臭化メチル(537) + TX、ノルボルミド(1318) + TX、ホスアセチム(1336) + TX、ホスフィン(IUPAC名)(640) + TX、リン[CCN] + TX、ピンドン(1341) + TX、亜ヒ酸カリウム[CCN] + TX、ピリヌロン(1371) + TX、シリロシド(1390) + TX、亜ヒ酸ナトリウム[CCN] + TX、シアン化ナトリウム(444) + TX、フルオロ酢酸ナトリウム(735) + TX、ストリキニン(745) + TX、硫酸タリウム[CCN] + TX、ワルファリン(851)および亜鉛ホスフィド(640) + TXから構成される物質群から選択される殺鼠剤、

2-(2-プトキシエトキシ)-エチルピペロニレート(IUPAC名)(934) + TX、5-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)-3-ヘキシルシクロヘキサ-2-エノン(IUPAC名)(903) + TX、ファルネソールを伴うネロリドール(代替名)(324) + TX、MB-599(開発コード)(498) + TX、MGK264(開発コード)(296) + TX、ピペロニルプトキシド(649) + TX、ピプロタル(1343) + TX、プロピル異性体(1358) + TX、S421(開発コード)(724) + TX、セサメックス(1393) + TX、セサスモリン(1394)およびスル

ホキシド(1406) + TX から構成される物質群から選択される共力剤、

アントラキノ(32) + TX、クロラロース(127) + TX、ナフテン酸銅 [CCN] + TX、オキシ塩化銅(171) + TX、ダイアジノン(227) + TX、ジシクロペンタジエン(化学名)(1069) + TX、グアザチン(422) + TX、グアザチン酢酸塩(422) + TX、メチオカルブ(530) + TX、ピリジン-4-アミン(IUPAC名)(23) + TX、チラム(804) + TX、トリメタカルブ(840) + TX、ナフテン酸亜鉛 [CCN] およびジラム(856) + TX から構成される物質群から選択される動物忌避剤、

イマニン(代替名) [CCN] およびリバピリン(代替名) [CCN] + TX から構成される物質群から選択される抗ウイルス剤、

酸化水銀(II)(512) + TX、オクチリノン(590) およびチオフアネートメチル(802) + TX から構成される物質群から選択される創傷保護剤、

ならびに、アメトクトラジン [865318-97-4] + TX、アミスルプロム [348635-87-0] + TX、アザコナゾール [60207-31-0] + TX、ベンゾピンジフルピル [1072957-71-1] + TX、ピテルタノール [70585-36-3] + TX、ピキサフェン [581809-46-3] + TX、プロムコナゾール [116255-48-2] + TX、クモキシストロピン [850881-70-8] + TX、シプロコナゾール [94361-06-5] + TX、ジフェノコナゾール [119446-68-3] + TX、ジニコナゾール [83657-24-3] + TX、エノキサストロピン [238410-11-2] + TX、エポキシコナゾール [106325-08-0] + TX、フェンブコナゾール [114369-43-6] + TX、フェンピラザミン [473798-59-3] + TX、フルキンコナゾール [136426-54-5] + TX、フルシラゾール [85509-19-9] + TX、フルトリアホール [76674-21-0] + TX、フルキサピロキサド [907204-31-3] + TX、フルオピラム [658066-35-4] + TX、フェナミンストロピン [366815-39-6] + TX、イソフェタミド [875915-78-9] + TX、ヘキサコナゾール [79983-71-4] + TX、イマザリル [35554-44-0] + TX、イミベンコナゾール [86598-92-7] + TX、イブコナゾール [125225-28-7] + TX、イブフェントリフルコナゾール [1417782-08-1] + TX、イソチアニル [224049-04-1] + TX、マンデストロピン [173662-97-0] (国際公開第2010/093059号に記載の手法に従って調製可能) + TX、メフェントリフルコナゾール [1417782-03-6] + TX、メトコナゾール [125116-23-6] + TX、ミクロブタニル [88671-89-0] + TX、パクロブトラゾール [76738-62-0] + TX、ペフラゾエート [101903-30-4] + TX、ペンフルフェン [494793-67-8] + TX、ペンコナゾール [66246-88-6] + TX、プロチオコナゾール [178928-70-6] + TX、ピリフェノックス [88283-41-4] + TX、プロクロラズ [67747-09-5] + TX、プロピコナゾール [60207-90-1] + TX、シメコナゾール [149508-90-7] + TX、テブコナゾール [107534-96-3] + TX、テトラコナゾール [112281-77-3] + TX、トリアジメホン [43121-43-3] + TX、トリアジメノール [55219-65-3] + TX、トリフルミゾール [99387-89-0] + TX、トリチコナゾール [131983-72-7] + TX、アンシミドール [12771-68-5] + TX、フェナリモル [60168-88-9] + TX、ヌアリモル [63284-71-9] + TX、ブピリメート [41483-43-6] + TX、ジメチリモール [5221-53-4] + TX、エチリモール [23947-60-6] + TX、ドデモルフ [1593-77-7] + TX、フェンプロピジン [67306-00-7] + TX、フェンプロピモルフ [67564-91-4] + TX、スピロキサミン [118134-30-8] + TX、トリデモルフ [81412-43-3] + TX、シプロジニル [121552-61-2] + TX、メパニピリム [110235-47-7] + TX、ピリメタニル [53112-28-0] + TX、フェンピクロニ

10

20

30

40

50

ル [7 4 7 3 8 - 1 7 - 3] + T X、フルジオキソニル [1 3 1 3 4 1 - 8 6 - 1] + T X、フルインダピル [1 3 8 3 8 0 9 - 8 7 - 7] + T X、ベナラキシル [7 1 6 2 6 - 1 1 - 4] + T X、フララキシル [5 7 6 4 6 - 3 0 - 7] + T X、メタラキシル [5 7 8 3 7 - 1 9 - 1] + T X、R - メタラキシル [7 0 6 3 0 - 1 7 - 0] + T X、オフレース [5 8 8 1 0 - 4 8 - 3] + T X、オキサジキシル [7 7 7 3 2 - 0 9 - 3] + T X、ベノミル [1 7 8 0 4 - 3 5 - 2] + T X、カルベンダジム [1 0 6 0 5 - 2 1 - 7] + T X、デバカルブ [6 2 7 3 2 - 9 1 - 6] + T X、フベリダゾール [3 8 7 8 - 1 9 - 1] + T X、チアベンダゾール [1 4 8 - 7 9 - 8] + T X、クロゾリネート [8 4 3 3 2 - 8 6 - 5] + T X、ジクロゾリン [2 4 2 0 1 - 5 8 - 9] + T X、イプロジオン [3 6 7 3 4 - 1 9 - 7] + T X、ミクロゾリン [5 4 8 6 4 - 6 1 - 8] + T X、プロシミドン [3 2 8 0 9 - 1 6 - 8] + T X、ピンクロゾリン [5 0 4 7 1 - 4 4 - 8] + T X、ボスカリド [1 8 8 4 2 5 - 8 5 - 6] + T X、カルボキシシン [5 2 3 4 - 6 8 - 4] + T X、フェンフラム [2 4 6 9 1 - 8 0 - 3] + T X、フルトラニル [6 6 3 3 2 - 9 6 - 5] + T X、フルチアニル [9 5 8 6 4 7 - 1 0 - 4] + T X、メプロニル [5 5 8 1 4 - 4 1 - 0] + T X、オキシカルボキシシン [5 2 5 9 - 8 8 - 1] + T X、ペンチオピラド [1 8 3 6 7 5 - 8 2 - 3] + T X、チフルザミド [1 3 0 0 0 0 - 4 0 - 7] + T X、グアザチン [1 0 8 1 7 3 - 9 0 - 6] + T X、ドジン [2 4 3 9 - 1 0 - 3] [1 1 2 - 6 5 - 2] (遊離塩基) + T X、イミノクタジン [1 3 5 1 6 - 2 7 - 3] + T X、アゾキシストロピン [1 3 1 8 6 0 - 3 3 - 8] + T X、ジモキシストロピン [1 4 9 9 6 1 - 5 2 - 4] + T X、エネストロプリン { Proc . B C P C , Int . C ongr . , Glasg ow , 2 0 0 3 , 1 , 9 3 } + T X、フルオキサストロピン [3 6 1 3 7 7 - 2 9 - 9] + T X、クレソキシム - メチル [1 4 3 3 9 0 - 8 9 - 0] + T X、メトミノストロピン [1 3 3 4 0 8 - 5 0 - 1] + T X、トリフロキシストロピン [1 4 1 5 1 7 - 2 1 - 7] + T X、オリザストロピン [2 4 8 5 9 3 - 1 6 - 0] + T X、ピコキシストロピン [1 1 7 4 2 8 - 2 2 - 5] + T X、ピラクロストロピン [1 7 5 0 1 3 - 1 8 - 0] + T X、ピラオキシストロピン [8 6 2 5 8 8 - 1 1 - 2] + T X、フェルバム [1 4 4 8 4 - 6 4 - 1] + T X、マンコゼブ [8 0 1 8 - 0 1 - 7] + T X、マンネブ [1 2 4 2 7 - 3 8 - 2] + T X、メチラム [9 0 0 6 - 4 2 - 2] + T X、プロピネブ [1 2 0 7 1 - 8 3 - 9] + T X、チラム [1 3 7 - 2 6 - 8] + T X、ジネブ [1 2 1 2 2 - 6 7 - 7] + T X、ジラム [1 3 7 - 3 0 - 4] + T X、カプタホール [2 4 2 5 - 0 6 - 1] + T X、キャプタン [1 3 3 - 0 6 - 2] + T X、ジクロフルアニド [1 0 8 5 - 9 8 - 9] + T X、フルオロイミド [4 1 2 0 5 - 2 1 - 4] + T X、ホルベット [1 3 3 - 0 7 - 3] + T X、トリルフルアニド [7 3 1 - 2 7 - 1] + T X、ボルドー液 [8 0 1 1 - 6 3 - 0] + T X、水酸化銅 [2 0 4 2 7 - 5 9 - 2] + T X、塩化銅 [1 3 3 2 - 4 0 - 7] + T X、硫酸銅 [7 7 5 8 - 9 8 - 7] + T X、酸化銅 (I I) [1 3 1 7 - 3 9 - 1] + T X、マンカップ [5 3 9 8 8 - 9 3 - 5] + T X、オキシシン銅 [1 0 3 8 0 - 2 8 - 6] + T X、ジノカップ [1 3 1 - 7 2 - 6] + T X、ニトロタルイソプロピル [1 0 5 5 2 - 7 4 - 6] + T X、エディフェンホス [1 7 1 0 9 - 4 9 - 8] + T X、イプロベンホス [2 6 0 8 7 - 4 7 - 8] + T X、イソプロチオラン [5 0 5 1 2 - 3 5 - 1] + T X、ホスジフェン [3 6 5 1 9 - 0 0 - 3] + T X、ピラゾホス [1 3 4 5 7 - 1 8 - 6] + T X、トルコホス - メチル [5 7 0 1 8 - 0 4 - 9] + T X、アシベンゾラル - S - メチル [1 3 5 1 5 8 - 5 4 - 2] + T X、アニラジン [1 0 1 - 0 5 - 3] + T X、ベンチアパリカルブ [4 1 3 6 1 5 - 3 5 - 7] + T X、プラストサイジン - S [2 0 7 9 - 0 0 - 7] + T X、キノメチオネート [2 4 3 9 - 0 1 - 2] + T X、クロロネブ [2 6 7 5 - 7 7 - 6] + T X、クロロタロニル [1 8 9 7 - 4 5 - 6] + T X、シフルフェナミド [1 8 0 4 0 9 - 6 0 - 3] + T X、シモキサニル [5 7 9 6 6 - 9 5 - 7] + T X、ジクロン [1 1 7 - 8 0 - 6] + T X、ジクロシメット [1 3 9 9 2 0 - 3 2 - 4] + T X、ジクロメジン [6 2 8 6 5 - 3 6 - 5] + T X、ジクロラン [9 9 - 3 0 - 9] + T X、ジエトフェンカルブ [8 7 1 3 0 - 2 0 - 9] + T X、ジメトモルフ [1 1 0 4 8 8 - 7 0 - 5] + T X、S Y P - L I 9 0 (フル

モルフ) [2 1 1 8 6 7 - 4 7 - 9] + T X、ジチアノン [3 3 4 7 - 2 2 - 6] + T X
 、エタボキサム [1 6 2 6 5 0 - 7 7 - 3] + T X、エトリジアゾール [2 5 9 3 - 1 5
 - 9] + T X、ファモキサドン [1 3 1 8 0 7 - 5 7 - 3] + T X、フェンアミドン [1
 6 1 3 2 6 - 3 4 - 7] + T X、フェノキサニル [1 1 5 8 5 2 - 4 8 - 7] + T X、フ
 エンチン [6 6 8 - 3 4 - 8] + T X、フェリムゾン [8 9 2 6 9 - 6 4 - 7] + T X、
 フルアジナム [7 9 6 2 2 - 5 9 - 6] + T X、フルオピコリド [2 3 9 1 1 0 - 1 5 -
 7] + T X、フルスルファミド [1 0 6 9 1 7 - 5 2 - 6] + T X、フェンヘキサミド [
 1 2 6 8 3 3 - 1 7 - 8] + T X、ホセチル - アルミニウム [3 9 1 4 8 - 2 4 - 8] +
 T X、ヒメキサゾール [1 0 0 0 4 - 4 4 - 1] + T X、イプロバリカルブ [1 4 0 9 2
 3 - 1 7 - 7] + T X、I K F - 9 1 6 (シアゾファミド) [1 2 0 1 1 6 - 8 8 - 3] 10
 + T X、カスガマイシン [6 9 8 0 - 1 8 - 3] + T X、メタスルホカルブ [6 6 9 5 2
 - 4 9 - 6] + T X、メトラフェノン [2 2 0 8 9 9 - 0 3 - 6] + T X、ペンシクロン
 [6 6 0 6 3 - 0 5 - 6] + T X、フタリド [2 7 3 5 5 - 2 2 - 2] + T X、ピカルブ
 トラゾクス [5 0 0 2 0 7 - 0 4 - 5] + T X、ポリオキシシン [1 1 1 1 3 - 8 0 - 7]
 + T X、プロベナゾール [2 7 6 0 5 - 7 6 - 1] + T X、プロパモカルブ [2 5 6 0 6
 - 4 1 - 1] + T X、プロキナジド [1 8 9 2 7 8 - 1 2 - 4] + T X、ピジフルメトフ
 エン [1 2 2 8 2 8 4 - 6 4 - 7] + T X、ピラメトストロピン [9 1 5 4 1 0 - 7 0 -
 7] + T X、ピロキロン [5 7 3 6 9 - 3 2 - 1] + T X、ピリオフェノン [6 8 8 0 4
 6 - 6 1 - 9] + T X、ピリベンカルブ [7 9 9 2 4 7 - 5 2 - 2] + T X、ピリゾキサ
 ザール [8 4 7 7 4 9 - 3 7 - 5] + T X、キノキシフェン [1 2 4 4 9 5 - 1 8 - 7] 20
 + T X、キントゼン [8 2 - 6 8 - 8] + T X、硫黄 [7 7 0 4 - 3 4 - 9] + T X、T
 i m o r e x G o l d (商 標) (S t o c k t o n G r o u p 製 の テ ィ ー ツ リ ー オ イ ル
 を 含 む 植 物 抽 出 物) + T X、テブフロキン [3 7 6 6 4 5 - 7 8 - 2] + T X、チアジ
 ニル [2 2 3 5 8 0 - 5 1 - 6] + T X、トリアゾキシド [7 2 4 5 9 - 5 8 - 6] + T
 X、トルプロカルブ [9 1 1 4 9 9 - 6 2 - 2] + T X、トリクロピリカルブ [9 0 2 7
 6 0 - 4 0 - 1] + T X、トリシクラゾール [4 1 8 1 4 - 7 8 - 2] + T X、トリホリ
 ン [2 6 6 4 4 - 4 6 - 2] + T X、バリダマイシン [3 7 2 4 8 - 4 7 - 8] + T X、
 バリフェナレート [2 8 3 1 5 9 - 9 0 - 0] + T X、ゾキサミド (R H 7 2 8 1) [1
 5 6 0 5 2 - 6 8 - 5] + T X、マンジプロパミド [3 7 4 7 2 6 - 6 2 - 2] + T X、
 イソピラザム [8 8 1 6 8 5 - 5 8 - 1] + T X、フェナマクリル + T X、セダキサシ 30
 [8 7 4 9 6 7 - 6 7 - 6] + T X、トリネキサバック - エチル [9 5 2 6 6 - 4 0 - 3]
 + T X、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (9 -
 ジクロロメチレン - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノ - ナフタレン - 5 -
 イル) - アミド (国際公開第 2 0 0 7 / 0 4 8 5 5 6 号 に 開 示 さ れ て い る) + T X、3 -
 ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (3 ' , 4 ' , 5 '
 - トリフルオロ - ビフェニル - 2 - イル) - アミド (国際公開第 2 0 0 6 / 0 8 7 3 4 3
 号 に 開 示 さ れ て い る) + T X、 [(3 S , 4 R , 4 a R , 6 S , 6 a S , 1 2 R , 1 2 a
 S , 1 2 b S) - 3 - [(シ ク ロ プ ロ ピ ル カ ル ボ ニ ル) オ キ シ] - 1 , 3 , 4 , 4 a , 5
 , 6 , 6 a , 1 2 , 1 2 a , 1 2 b - デ カ ヒ ド ロ - 6 , 1 2 - ジ ヒ ド ロ キ シ - 4 , 6 a ,
 1 2 b - ト リ メ チ ル - 1 1 - オ キ ソ - 9 - (3 - ピ リ ジ ニ ル) - 2 H , 1 1 H ナ フ ト [2 40
 ,
 1 - b] ピ ラ ノ [3 , 4 - e] ピ ラ ン - 4 - イ ル] メ チ ル - シ ク ロ プ ロ パ ン カ ル ボ キ シ レ
 ート [9 1 5 9 7 2 - 1 7 - 7] + T X お よ び 1 , 3 , 5 - ト リ メ チ ル - N - (2 - メ チ
 ル - 1 - オ キ ソ プ ロ ピ ル) - N - [3 - (2 - メ チ ル プ ロ ピ ル) - 4 - [2 , 2 , 2 - ト
 リ フ ル オ ロ - 1 - メ ト キ シ - 1 - (ト リ フ ル オ ロ メ チ ル) エ チ ル] フェ ニ ル] - 1 H - ピ
 ラ ザ ール - 4 - カ ル ボ キ サ ミ ド [9 2 6 9 1 4 - 5 5 - 8] + T X から なる 群 から 選 択 さ
 れ る 生 物 学 的 に 有 効 な 化 合 物、
 または、N - [(5 - ク ロ ロ - 2 - イ ソ プ ロ ピ ル - フェ ニ ル) メ チ ル] - N - シ ク ロ プ
 ロ ピ ル - 3 - (ジ フ ル オ ロ メ チ ル) - 5 - フ ル オ ロ - 1 - メ チ ル - ピ ラ ザ ール - 4 - カ ル
 ボ キ サ ミ ド (国際公開第 2 0 1 0 / 1 3 0 7 6 7 号 に 記 載 の 手 法 に 従 っ て 調 製 可 能) + T 50

X、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) - テトロン (国際公開第2011/1382
 81号に記載の手法に従って調製可能) + TX、6 - エチル - 5、7 - ジオキソ - ピロロ
 [4、5][1、4]ジチイノ[1、2 - c]イソチアゾール - 3 - カルボニトリル + T
 X、4 - (2 - プロモ - 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 (国際公開第2012/031
 061号に記載の手法に従って調製可能) + TX、3 - (ジフルオロメチル) - N - (7
 - フルオロ - 1、1、3 - トリメチル - インダン - 4 - イル) - 1 - メチル - ピラゾール
 - 4 - カルボキサミド (国際公開第2012/084812号に記載の手法に従って調製
 可能) + TX、CAS 850881 - 30 - 0 + TX、3 - (3、4 - ジクロロ - 1、2
 - チアゾール - 5 - イルメトキシ) - 1、2 - ベンゾチアゾール 1、1 - ジオキソ (国
 際公開第2007/129454号に記載の手法に従って調製可能) + TX、2 - [2 -
 [(2、5 - ジメチルフェノキシ)メチル]フェニル] - 2 - メトキシ - N - メチル - ア
 セトアミド + TX、3 - (4、4 - ジフルオロ - 3、4 - ジヒドロ - 3、3 - ジメチルイ
 ソキノリン - 1 - イル)キノロン (国際公開第2005/070917号に記載の手法に
 従って調製可能) + TX、2 - [2 - フルオロ - 6 - [(8 - フルオロ - 2 - メチル - 3
 - キノリル)オキシ]フェニル]プロパン - 2 - オール (国際公開第2011/0811
 74号に記載の手法に従って調製可能) + TX、2 - [2 - [(7、8 - ジフルオロ - 2
 - メチル - 3 - キノリル)オキシ] - 6 - フルオロ - フェニル]プロパン - 2 - オール (国
 際公開第2011/081174号に記載の手法に従って調製可能) + TX、オキサチ
 アピプロリン + TX [1003318 - 67 - 9]、t - ブチル N - [6 - [[[(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 + TX、N - [2 - (3、4 - ジフルオロフェニル)フェニル]
 - 3 - (トリフルオロメチル)ピラジン - 2 - カルボキサミド (国際公開第2007/0
 72999号に記載の手法に従って調製可能) + TX、3 - (ジフルオロメチル) - 1 -
 メチル - N - [(3R) - 1、1、3 - トリメチルインダン - 4 - イル]ピラゾール - 4
 - カルボキサミド (国際公開第2014/013842号に記載の手法に従って調製可能
) + TX、2、2、2 - トリフルオロエチル N - [2 - メチル - 1 - [[[(4 - メチルベ
 ンゾイル)アミノ]メチル]プロピル]カルバメート + TX、(2RS) - 2 - [4 - (4
 - クロロフェノキシ) - , - トリフルオロ - o - トリル] - 1 - (1H - 1、
 2、4 - トリアゾール - 1 - イル)プロパン - 2 - オール + TX、(2RS) - 2 - [4
 - (4 - クロロフェノキシ) - , - トリフルオロ - o - トリル] - 3 - メチル -
 1 - (1H - 1、2、4 - トリアゾール - 1 - イル)ブタン - 2 - オール + TX、2 - (ジ
 フルオロメチル) - N - [(3R) - 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 + TX、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 + TX、
 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 + TX、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 (国際公開第
 2007/031513号に記載の手法に従って調製可能) + TX、[2 - [3 - [2 -
 [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]チアゾール - 4 - イル] - 4、5 - ジヒドロイソキサゾール - 5 - イル
] - 3 - クロロ - フェニル]メタンスルホン酸 (国際公開第2012/025557号に
 記載の手法に従って調製可能) + TX、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 (国際公開第2010/000841号に記載の手法に従って
 調製可能) + TX、2 - [[3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2、4 - ジフルオロフ
 ェニル)オキシラン - 2 - イル]メチル] - 4H - 1、2、4 - トリアゾール - 3 - チオ
 ン (国際公開第2010/146031号に記載の手法に従って調製可能) + TX、メチ
 ル N - [[5 - [4 - (2、4 - ジメチルフェニル)トリアゾール - 2 - イル] - 2 - メ

チル - フェニル] メチル] カルバメート + TX、 3 - クロロ - 6 - メチル - 5 - フェニル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリフルオロフェニル) ピリダジン (国際公開第 2 0 0 5 / 1 2 1 1 0 4 号に記載の手法に従って調製可能) + TX、 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ) 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 (国際公開第 2 0 1 3 / 0 2 4 0 8 2 号に記載の手法に従って調製可能) + TX、 3 - クロロ - 4 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 6 - メチル - 5 - フェニル - ピリダジン (国際公開第 2 0 1 2 / 0 2 0 7 7 4 号に記載の手法に従って調製可能) + TX、 4 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 6 - メチル - 5 - フェニル - ピリダジン - 3 - カルボニトリル (国際公開第 2 0 1 2 / 0 2 0 7 7 4 号に記載の手法に従って調製可能) + TX、 (R) - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル] ピラゾール - 4 - カルボキサミド (国際公開第 2 0 1 1 / 1 6 2 3 9 7 号に記載の手法に従って調製可能) + TX、 3 - (ジフルオロメチル) - N - (7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - インダン - 4 - イル) - 1 - メチル - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (国際公開第 2 0 1 2 / 0 8 4 8 1 2 号に記載の手法に従って調製可能) + TX、 1 - [2 - [[1 - (4 - クロロフェニル) ピラゾール - 3 - イル] オキシメチル] - 3 - メチル - フェニル] - 4 - メチル - テトラゾール - 5 - オン (国際公開第 2 0 1 3 / 1 6 2 0 7 2 号に記載の手法に従って調製可能) + TX、 1 - メチル - 4 - [3 - メチル - 2 - [[2 - メチル - 4 - (3 , 4 , 5 - トリメチルピラゾール - 1 - イル) フェノキシ] メチル] フェニル] テトラゾール - 5 - オン (国際公開第 2 0 1 4 / 0 5 1 1 6 5 号に記載の手法に従って調製可能) + TX、 (Z , 2 E) - 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 - ペンタ - 3 - エンアミド + TX、 (4 - フェノキシフェニル) メチル 2 - アミノ - 6 - メチル - ピリジン - 3 - カルボキシレート + TX、 N - (5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル) - N - シクロプロピル - 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 [1 2 5 5 7 3 4 - 2 8 - 1] (国際公開第 2 0 1 0 / 1 3 0 7 6 7 号に記載の手法に従って調製可能) + TX、 3 - (ジフルオロメチル) - N - [(R) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチルピラゾール - 4 - カルボキサミド [1 3 5 2 9 9 4 - 6 7 - 2] + TX、 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 + TX、 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 + TX、 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 + TX、 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 + TX、

【化 1 7】

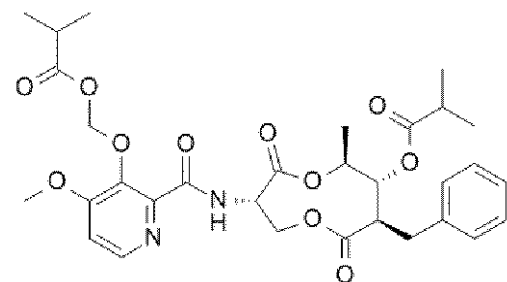
10

20

30

40

50



(フェンピコキサミド [5 1 7 8 7 5 - 3 4 - 2]) + TX (国際公開第 2 0 0 3 / 0 3 5 6 1 7 号に記載のとおり)、 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 + TX、 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 + TX、 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 + TX、 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+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-[(3R)-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+TX、2-(ジフルオロメチル)-N-[(3R)-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+TXおよび2-(ジフルオロメチル)-N-[(3R)-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+TX(ここで、これらのカルボキサミド化合物の各々は、国際公開第2014/095675号および/または国際公開第2016/139189号に記載の手法に従って調製可能である)からなる群から選択される生物学的に有効な化合物。

【0148】

例えば[3878-19-1]といった有効成分に続く括弧中の参照は、Chemical Abstracts Registry numberを指している。上記の混合相手は公知である。有効成分が「The Pesticide Manual」[The Pesticide Manual - A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C. D. S. Tomlin; The British Crop Protection Council]中に含まれている場合、これらは、特定の化合物について本明細書中上記の丸括弧中に示されている項目番号下でその中に記載されており;例えば、化合物「アバメクチン」は、項目番号(1)下に記載されている。上記に記載の特定の化合物について「[CCN]」が付記されている場合、対象の化合物は[A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright (著作権) 1995-2004]にてインターネットを介してアクセス可能である「Compendium of Pesticide Common Names」に含まれており;例えば、化合物「アセトプロール」は、インターネットアドレス<http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>において記載されている。

【0149】

上記明細書において、上記の活性成分の大部分は、いわゆる「慣用名」、関連する「ISO慣用名」または他の「慣用名」を個々の事例において用いることにより言及されている。「慣用名」による呼称ではない場合、代わりに用いられる呼称の性質は特定の化合物について丸括弧中に記載されており;この場合、IUPAC名、IUPAC/Chemical Abstracts名、「化学名」、「慣習名」、「化合物名」もしくは「開発コード」が用いられており、または、これらの呼称もしくは「慣用名」のいずれも用いられていない場合には、「代替名」が採用されている。「CAS登録番号」はChemical Abstracts Registry numberを意味する。

【0150】

表T1(以下)に記載の化合物1.1~1.27、表T2(以下)に記載の化合物2.1~2.3、表T3(以下)に記載の化合物3.1~3.11、または、表T4(以下)に記載の化合物4.1~4.4から選択される式(I)の化合物と、上記に記載されている活性成分との活性成分混合物は、好ましくは、100:1~1:6000、特に50:1~1:50の混合比であり、特に20:1~1:20、特に10:1~1:10、特に5:1および1:5の比であり、2:1~1:2の比が特別に好ましく、ならびに、4:1~2:1の比が同様に好ましく、とりわけ、1:1、または、5:1、または、5:2、または、5:3、または、5:4、または、4:1、または、4:2、または、4:3、または、3:1、または、3:2、または、2:1、または、1:5、または、2:5、または、3:5、または、4:5、または、1:4、または、2:4、または、3:4、または、1:3、または、2:3、または、1:2、または、1:600、または、1:300、または、1:150、または、1:35、または、2:35、または、4:35、または、1:75、または、2:75、または、4:75、または、1:6000、または、1:3000、または、1:1500、または、1:350、または、2:350、または、4:350、または、1:750、または、2:750、または、4:750の比が好ましい。これらの混合比は重量基準である。

10

20

30

40

50

【0151】

上記の混合物は、上記の混合物を含む組成物を有害生物もしくはその環境に適用するステップを含む有害生物を防除する方法において用いられることが可能であるが、手術もしくは治療によるヒトもしくは動物の身体の処置法、および、ヒトまたは動物の身体において実施される診断法は除かれる。

【0152】

表1.1~1.12、2.1~2.4、3.1~3.7(以下)、または、表T1、T2、T3もしくはT4(以下)の1つから選択される式(I)の化合物と、上記に記載されている1種以上の活性成分とを含む混合物は、例えば、単一の「調合済み」の形態で、単一の活性成分コンポーネントの個々の配合物から組成される「タンク混合物」などの複
10
合型噴霧混合物で、および、逐次的(すなわち、数時間または数日間などの適度に短時間のうちに次々と)に適用される場合には単一の活性成分を併用して適用されることが可能である。表1.1~1.12または表2.1~2.4または表3.1~3.7(以下)または表T1、T2、T3もしくはT4(以下)から選択される式(I)の化合物と、上記に記載の活性成分とを適用する順番は、本発明の作用については重要ではない。

【0153】

本発明に係る組成物はまた、例えば無エポキシ化もしくはエポキシ化植物油(例えばエポキシ化ココナツ油、ナタネ油または大豆油)といった安定剤、例えばシリコン油といった消泡剤、防腐剤、粘度調整剤、バインダおよび/もしくは粘着剤、肥料、または、例えば殺菌剤、殺菌剤(殺真菌剤)、抗線虫薬、植物活性化剤、殺軟体動物剤もしくは除草
20
剤といった特定の効果を達成するための他の活性成分などのさらなる固体もしくは液体助剤を含んでいることが可能である。

【0154】

本発明に係る組成物は、それ自体は公知である様式において、助剤の不在下で、例えば、活性成分を粉末化し、スクリーニングし、および/または、固体に圧縮することにより調製され、ならびに、少なくとも1種の助剤の存在下に、例えば活性成分を助剤と共に均質混合し、および/または、粉末化することにより調製される。これらの組成物の調製プ
ロセスおよびこれらの組成物の調製に係る化合物(I)の使用もまた本発明の主題である。

【0155】

本発明の他の態様は、式(I)の化合物もしくは本明細書に定義されている好ましい個別の化合物、少なくとも1種の式(I)の化合物もしくは少なくとも1種の上記に定義されている好ましい個別の化合物を含む組成物、または、少なくとも1種の式(I)の化合物もしくは少なくとも1種の上記に定義されている好ましい個別の化合物を含む殺菌性もしくは殺虫性混合物であって、上記の他の殺菌剤(殺真菌剤)もしくは殺虫剤を伴う混和物における使用であり、作物植物、例えば種子といったその繁殖体、例えば収穫された食品作物といった収穫された作物などの例えば有用な植物といった植物、または、昆虫もしくは好ましくは真菌性生物といった植物病原性微生物による非生体材料に係る外寄生を防
30
除もしくは予防するための使用に関する。

【0156】

本発明のさらなる態様は、作物植物、例えば種子といったその繁殖体、例えば収穫された食品作物といった収穫された作物などの例えば有用な植物といった植物、または、昆虫、もしくは、特に真菌性生物といった植物病原性もしくはヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物もしくは生物による非生体材料に係る外寄生を防除もしくは予防する方法に関し、この方法は、式(I)の化合物もしくは上記に定義されている好ましい個別の化合物を、活性成分として植物、植物の一部もしくはその生息地、その繁殖体、または、非生体材料のいずれかの部分に適用するステップを含む。

【0157】

防除もしくは予防とは、特に真菌性生物といった植物病原性もしくはヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物もしくは生物による外寄生を、向上が実証されるレベルまで
40
50

低減させることを意味する。

【0158】

特に真菌性生物といった植物病原性微生物または昆虫による作物植物の外寄生を防除もしくは予防する好ましい方法であって、式(I)の化合物または前記化合物の少なくとも1種を含有する農芸化学組成物の適用を含む方法は、葉面処理である。適用頻度および適用量は、対応する病原体または昆虫による外寄生のリスクに応じることとなる。しかしながら、式(I)の化合物はまた、植物の生息地に液体配合物を灌注することにより、または、例えば粒状形態(土壌施用)の固体形態で化合物を土壌に適用することにより、土壌(浸透移行作用)を介して根から植物に浸透させることが可能である。水稻作物の場合、このような粒質物を湛水した水田に適用することが可能である。式Iの化合物はまた、種子または塊茎を殺菌剤の液体配合物に含浸させることにより、または、これらを固体配合物でコーティングすることにより、種子に適用(コーティング)され得る。

10

【0159】

例えば、式(I)の化合物と、所望の場合に、式(I)の化合物をカプセル化する固体または液体補助剤またはモノマーとを含有する組成物といった配合物は、公知の様式で、典型的には、化合物を例えば溶剤、固体キャリアおよび任意選択により表面活性化合物(界面活性剤)といった増量剤と一緒に均質に混合し、および/または、粉砕することにより調製され得る。

【0160】

有利な適用量は、通常、1ヘクタール(ha)当たり、5g~2kgの活性成分(a.i.)、好ましくは10g~1kg a.i./ha、最も好ましくは20g~600g a.i./haである。種子灌注剤として用いられる場合、簡便な投与量は、1kgの種子に対して10mg~1gの活性物質である。

20

【0161】

本発明の組み合わせが種子の処理に用いられる場合、1kgの種子に対して0.001~50gの式Iの化合物、好ましくは、1kgの種子に対して0.01~10gの量が一般に十分とされる。

【0162】

好適には、本発明に係る式(I)の化合物を含む組成物は、病害の発生前を意味する予防的に、または、病害の発生後を意味する治療的に適用される。

30

【0163】

本発明の組成物は、いずれかの従来形態、例えば、二液系、乾燥種子処理用粉末(DS)、種子処理用エマルジョン(ES)、種子処理用流動性濃縮物(FS)、種子処理用溶液(LS)、種子処理用水分散性粉末(WS)、種子処理用カプセル懸濁液(CF)、種子処理用ゲル(GF)、エマルジョン濃縮物(EC)、懸濁液濃縮物(SC)、サスポエマルジョン(SE)、カプセル懸濁液(CS)、水分散性顆粒(WG)、乳化性顆粒(EG)、エマルジョン、油中水型(EO)、エマルジョン、水中油型(EW)、マイクロエマルジョン(ME)、油分散体(OD)、油混和性の流動体(OF)、混油性液体(OL)、可溶性濃縮物(SL)、超低体積懸濁液(SU)、超低体積液体(UL)、工業用濃縮物(TK)、分散性濃縮物(DC)、水和剤(WP)、または、農学的に許容可能な補助剤と組み合わせられるいずれかの技術的に好ましい配合物の形態で採用され得る。

40

【0164】

このような組成物は、従来様式で、例えば活性成分を、適切な不活性配合物(希釈剤、溶剤、充填材、ならびに、界面活性剤、殺生剤、不凍剤、展着剤、増粘剤およびアジュバント活性効果をもたらす化合物などの任意選択により他の配合成分)と混合することにより、生成され得る。また、従来緩効性配合物は、長期にわたって持続する効力が意図される場合に採用され得る。特に、水分散性濃縮物(例えばEC、SC、DC、OD、SE、EW、EO等)、水和剤および顆粒などの吹付け形態で適用される配合物は、例えばホルムアルデヒドとナフタレンスルホン酸塩との縮合物、アルキルアリアルスルホネート、リグニンスルホン酸塩、脂肪アルキルスルフェート、およびエトキシ化アルキルフェ

50

ノールおよびエトキシ化脂肪族アルコールといった、湿潤剤および分散剤およびアジュバント効果をもたらす他の化合物などの界面活性剤を含有していてもよい。

【0165】

種子粉衣配合物は種子にそれ自体公知である様式で適用され、例えば水性懸濁液または種子に良好な接着性を有する乾燥粉末形態といった好適な種子粉衣配合物形態で、本発明の組み合わせおよび希釈剤を利用する。このような種子粉衣配合物は技術分野において公知である。種子粉衣配合物は、単一種の活性成分を含有していても、または、例えば緩効性カプセルもしくはマイクロカプセルとしてカプセル化形態で活性成分の組み合わせを含有していてもよい。

【0166】

普通、配合物は、0.01～90重量%の活性薬剤、0～20%の農学的に許容可能な界面活性剤、ならびに、10～99.99%の固体または液体不活性配合物および補助剤を含み、活性薬剤は、少なくとも式(I)の化合物を、任意選択により他の活性薬剤、特に殺菌剤または防腐剤等を一緒に伴って構成されている。組成物の濃縮形態は、一般に、約2～80%、好ましくは約5～70重量%の活性薬剤を含有する。配合物の適用形態は、例えば0.01～20重量%、好ましくは0.01～5重量%の活性薬剤を含有し得る。市販製品は濃縮物として配合されていることが好ましいであろうが、エンドユーザーは通常希釈した配合物を利用することとなる。

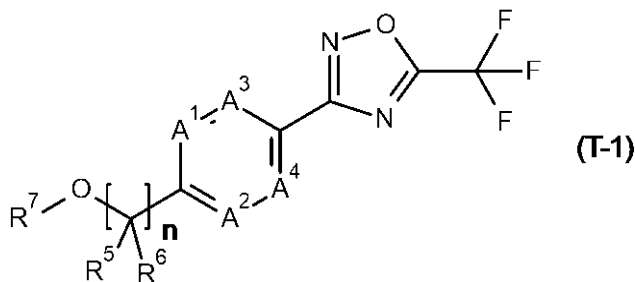
【0167】

市販の製品を濃縮物として配合することが好ましいが、エンドユーザーは通常配合物を希釈して使用するであろう。

【0168】

表1.1: この表は、199種の特定の式(T-1)の化合物を開示するものであり:

【化18】



式中、nは1であり、A¹はC-R¹であり、A²はC-R²であり、A³はC-R³であり、A⁴はC-R⁴であり、ならびに、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵およびR⁶は水素であり、ならびに、R⁷は表1において以下に定義されているとおりである。

【0169】

表1.2～1.12の各々(表1に続く)は199種の個々の式(T-1)の化合物を提供するものであり、式中、n、A¹、A²、A³、A⁴、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵およびR⁶は、R⁷が特定の定義されている表1を参照する表1.2～1.12において特定の定義されているとおりである。

【0170】

表1

10

20

30

40

【表 1 - 1】

化合物 番号	R ⁷	化合物 番号	R ⁷
1.001	2-フルオロフェニル	1.101	2-クロロ-4-ピリジル
1.002	3-フルオロフェニル	1.102	6-メチル-4-ピリジル
1.003	4-フルオロフェニル	1.103	5-メチル-4-ピリジル
1.004	2-クロロフェニル	1.104	2-メチル-4-ピリジル
1.005	3-クロロフェニル	1.105	6-シアノ-4-ピリジル
1.006	4-クロロフェニル	1.106	5-シアノ-4-ピリジル
1.007	2-プロモフェニル	1.107	2-シアノ-4-ピリジル
1.008	3-プロモフェニル	1.108	3,5-ジフルオロ-4-ピリジル
1.009	4-プロモフェニル	1.109	3,6-ジフルオロ-4-ピリジル
1.010	2-シアノフェニル	1.110	3,5-ジクロロ-4-ピリジル
1.011	3-シアノフェニル	1.111	3,6-ジクロロ-4-ピリジル
1.012	4-シアノフェニル	1.112	6-トリフルオロメチル-2-ピリジル
1.013	2-メチルフェニル	1.113	5-トリフルオロメチル-2-ピリジル
1.014	3-メチルフェニル	1.114	4-トリフルオロメチル-2-ピリジル
1.015	4-メチルフェニル	1.115	3-トリフルオロメチル-2-ピリジル
1.016	2-トリフルオロフェニル	1.116	6-ジフルオロメチル-2-ピリジル
1.017	3-トリフルオロフェニル	1.117	5-ジフルオロメチル-2-ピリジル
1.018	4-トリフルオロフェニル	1.118	4-ジフルオロメチル-2-ピリジル
1.019	2-ジフルオロフェニル	1.119	3-ジフルオロメチル-2-ピリジル
1.020	3-ジフルオロフェニル	1.120	6-ジフルオロメトキシ-2-ピリジル
1.021	4-ジフルオロフェニル	1.121	5-ジフルオロメトキシ-2-ピリジル
1.022	2-メトキシフェニル	1.122	4-ジフルオロメトキシ-2-ピリジル
1.023	3-メトキシフェニル	1.123	3-ジフルオロメトキシ-2-ピリジル
1.024	4-メトキシフェニル	1.124	6-トリフルオロメチル-4-ピリジル
1.025	2,3-ジフルオロフェニル	1.125	5-トリフルオロメチル-4-ピリジル
1.026	2,4-ジフルオロフェニル	1.126	2-トリフルオロメチル-4-ピリジル
1.027	2,5-ジフルオロフェニル	1.127	6-ジフルオロメチル-4-ピリジル
1.028	2,6-ジフルオロフェニル	1.128	5-ジフルオロメチル-4-ピリジル
1.029	3,4-ジフルオロフェニル	1.129	2-ジフルオロメチル-4-ピリジル
1.030	3,5-ジフルオロフェニル	1.130	4-ピリミジニル
1.031	2,3-ジクロロフェニル	1.131	5-ピリミジニル
1.032	2,4-ジクロロフェニル	1.132	5-フルオロ-ピリミジニル
1.033	2,5-ジクロロフェニル	1.133	5-クロロ-ピリミジニル
1.034	2,6-ジクロロフェニル	1.134	5-メチル-ピリミジニル
1.035	3,4-ジクロロフェニル	1.135	2-チアゾリル
1.036	3,5-ジクロロフェニル	1.136	4-チアゾリル
1.037	2-ジフルオロメトキシフェニル	1.137	5-チアゾリル
1.038	4-ジフルオロメトキシフェニル	1.138	5-メチル-2-チアゾリル
1.039	3-ジフルオロメトキシフェニル	1.139	4-メチル-2-チアゾリル
1.040	2-チエニル	1.140	1H-イミダゾール-5-イル
1.041	3-チエニル	1.141	2-メチル-1H-イミダゾール-5-イル

10

20

30

40

【表 1 - 2】

1.042	5-フルオロ-2-チエニル	1.142	2-シアノ-1H-イミダゾール-5-イル
1.043	3,5-ジフルオロ-2-チエニル	1.143	5-メチル-1H-イミダゾール-2-イル
1.044	2,5-ジフルオロ-3-チエニル	1.144	5-シアノ-1H-イミダゾール-2-イル
1.045	5-クロロ-2-チエニル	1.145	1,2-ジメチルイミダゾール-5-イル
1.046	5-メチル-2-チエニル	1.146	2-シアノ-1-メチル-イミダゾール-5-イル
1.047	5-シアノ-2-チエニル	1.147	1,5-ジメチルイミダゾール-2-イル
1.048	2-ピリジル	1.148	5-シアノ-1-メチル-イミダゾール-2-イル
1.049	3-ピリジル	1.149	オキサゾール-2-イル
1.050	4-ピリジル	1.150	オキサゾール-4-イル
1.051	6-フルオロ-2-ピリジル	1.151	オキサゾール-5-イル
1.052	5-フルオロ-2-ピリジル	1.152	2-メチルオキサゾール-5-イル
1.053	4-フルオロ-2-ピリジル	1.153	2-シアノオキサゾール-5-イル
1.054	3-フルオロ-2-ピリジル	1.154	5-メチルオキサゾール-2-イル
1.055	6-クロロ-2-ピリジル	1.155	5-シアノオキサゾール-5-イル
1.056	5-クロロ-2-ピリジル	1.156	2-メチル-1,2,4-トリアゾール-3-イル
1.057	4-クロロ-2-ピリジル	1.157	オキサタン-3-イル
1.058	3-クロロ-2-ピリジル	1.158	チエタン-3-イル
1.059	6-メチル-2-ピリジル	1.159	1H-アゼチジン-3-イル
1.060	5-メチル-2-ピリジル	1.160	1-アシル-アゼチジン-3-イル
1.061	4-メチル-2-ピリジル	1.161	テトラヒドロピラン-4-イル
1.062	3-メチル-2-ピリジル	1.162	4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル
1.063	6-シアノ-2-ピリジル	1.163	5,5-ジメチル-4H-イソキサゾール-3-イル
1.064	5-シアノ-2-ピリジル	1.164	4,4-ジメチル-4H-イソキサゾール-3-イル
1.065	4-シアノ-2-ピリジル	1.165	5-メチルイソキサゾール-3-イル
1.066	3-シアノ-2-ピリジル	1.166	1-メチルテトラゾール-5-イル
1.067	3-クロロ-5-フルオロ-2-ピリジル	1.167	1H-ピラゾール-3-イル
1.068	5-クロロ-3-フルオロ-2-ピリジル	1.168	1-メチルピラゾール-3-イル
1.069	3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジル	1.169	1,5-ジメチルピラゾール-3-イル
1.070	6-フルオロ-3-ピリジル	1.170	1-アシルピラゾール-3-イル
1.071	5-フルオロ-3-ピリジル	1.171	3,4-ジヒドロ-2H-ピロール-5-イル
1.072	4-フルオロ-3-ピリジル	1.172	3,3-ジメチル-2,4-ジヒドロピロール-5-イル
1.073	2-フルオロ-3-ピリジル	1.173	2-オキソ-3,4-ジヒドロピロール-5-イル
1.074	6-クロロ-3-ピリジル	1.174	1H-ピロリジン-3-イル
1.075	5-クロロ-3-ピリジル	1.175	1-アシル-ピロリジン-4-イル
1.076	4-クロロ-3-ピリジル	1.176	テトラヒドロフラン-3-イル
1.077	2-クロロ-3-ピリジル	1.177	2,3,4,5-テトラヒドロピリジン-6-イル
1.078	6-メチル-3-ピリジル	1.178	2-オキソ-4,5-ジヒドロ-3H-ピリジン-6-イル

10

20

30

40

【表 1 - 3】

1.079	5-メチル-3-ピリジル	1.179	2-オキソ-4,4-ジメチル-3,5-ジヒドロ ピリジン-6-イル
1.080	4-メチル-3-ピリジル	1.180	1-メトキシ-ピペリジン-4-イル
1.081	2-メチル-3-ピリジル	1.181	1H-ピペリジン-4-イル
1.082	6-シアノ-3-ピリジル	1.182	1-アシル-ピペリジン-4-イル
1.083	5-シアノ-3-ピリジル	1.183	シクロプロピル
1.084	4-シアノ-3-ピリジル	1.184	シクロブチル
1.085	2-シアノ-3-ピリジル	1.185	シクロペンチル
1.086	4,5-ジフルオロ-3-ピリジル	1.186	シクロヘキシル
1.087	4,6-ジフルオロ-3-ピリジル	1.187	シクロペンタ-3-エン-1-イル
1.088	2,4-ジフルオロ-3-ピリジル	1.188	シクロヘキサ-2-エン-1-イル
1.089	2,5-ジフルオロ-3-ピリジル	1.189	メチル
1.090	2,6-ジフルオロ-3-ピリジル	1.190	エチル
1.091	4,5-ジクロロ-3-ピリジル	1.191	プロピル
1.092	4,6-ジクロロ-3-ピリジル	1.192	イソプロピル
1.093	2,4-ジクロロ-3-ピリジル	1.193	ブチル
1.094	2,5-ジクロロ-3-ピリジル	1.194	ペンチル
1.095	2,6-ジクロロ-3-ピリジル	1.195	プロプ-2-エン-1-イル
1.096	6-フルオロ-4-ピリジル	1.196	プロプ-2-イン-1-イル
1.097	5-フルオロ-4-ピリジル	1.197	2-メトキシエチル
1.098	2-フルオロ-4-ピリジル	1.198	2-エトキシエチル
1.099	6-クロロ-4-ピリジル	1.199	2-イソプロピルオキシエチル
1.100	5-クロロ-4-ピリジル		

10

20

【0171】

表 1. 2 : この表は、199種の特定の式 (T - 1) の化合物を開示するものであり、式中、n は 1 であり、A¹ は C - R¹ であり、A² は C - R² であり、A³ は C - R³ であり、A⁴ は C - R⁴ であり、ならびに、R²、R³、R⁴、R⁵ および R⁶ は水素であり、R¹ はフッ素であり、ならびに、R⁷ は、表 1 において上記に定義されているとおりである。

30

【0172】

表 1. 3 : この表は、199種の特定の式 (T - 1) の化合物を開示するものであり、式中、n は 1 であり、A¹ は C - R¹ であり、A² は C - R² であり、A³ は C - R³ であり、A⁴ は C - R⁴ であり、ならびに、R²、R³、R⁴、R⁵ および R⁶ は水素であり、R¹ は塩素であり、ならびに、R⁷ は、表 1 において上記に定義されているとおりである。

【0173】

表 1. 4 : この表は、199種の特定の式 (T - 1) の化合物を開示するものであり、式中、n は 1 であり、A¹ は C - R¹ であり、A² は C - R² であり、A³ は C - R³ であり、A⁴ は C - R⁴ であり、ならびに、R²、R³、R⁴、R⁵ および R⁶ は水素であり、R¹ はメチルであり、ならびに、R⁷ は、表 1 において上記に定義されているとおりである。

40

【0174】

表 1. 5 : この表は、199種の特定の式 (T - 1) の化合物を開示するものであり、式中、n は 1 であり、A¹ は N であり、A² は C - R² であり、A³ は C - R³ であり、A⁴ は C - R⁴ であり、ならびに、R²、R³、R⁴、R⁵ および R⁶ は水素であり、ならびに、R⁷ は、表 1 において上記に定義されているとおりである。

【0175】

表 1. 6 : この表は、199種の特定の式 (T - 1) の化合物を開示するものであり、式

50

中、 n は1であり、 A^1 は $C - R^1$ であり、 A^2 は $C - R^2$ であり、 A^3 は $C - R^3$ であり、 A^4 は $C - R^4$ であり、ならびに、 R^1 、 R^2 、 R^4 、 R^5 および R^6 は水素であり、 R^3 はフッ素であり、ならびに、 R^7 は、表1において上記に定義されているとおりである。

【0176】

表1.7: この表は、199種の特定の式(T-1)の化合物を開示するものであり、式中、 n は1であり、 A^1 は $C - R^1$ であり、 A^2 は $C - R^2$ であり、 A^3 は $C - R^3$ であり、 A^4 は $C - R^4$ であり、ならびに、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は水素であり、 R^1 および R^3 はフッ素であり、ならびに、 R^7 は、表1において上記に定義されているとおりである。

【0177】

表1.8: この表は、199種の特定の式(T-1)の化合物を開示するものであり、式中、 n は1であり、 A^1 は $C - R^1$ であり、 A^2 は $C - R^2$ であり、 A^3 は $C - R^3$ であり、 A^4 は $C - R^4$ であり、ならびに、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 は水素であり、 R^1 および R^2 はフッ素であり、ならびに、 R^7 は、表1において上記に定義されているとおりである。

10

【0178】

表1.9: この表は、199種の特定の式(T-1)の化合物を開示するものであり、式中、 n は1であり、 A^1 は $C - R^1$ であり、 A^2 は $C - R^2$ であり、 A^3 は $C - R^3$ であり、 A^4 は $C - R^4$ であり、ならびに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 は水素であり、 R^6 はメチルであり、ならびに、 R^7 は、表1において上記に定義されているとおりである。

【0179】

表1.10: この表は、199種の特定の式(T-1)の化合物を開示するものであり、式中、 n は1であり、 A^1 は N であり、 A^2 は $C - R^2$ であり、 A^3 は $C - R^3$ であり、 A^4 は $C - R^4$ であり、ならびに、 R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 は水素であり、 R^6 はメチルであり、ならびに、 R^7 は、表1において上記に定義されているとおりである。

20

【0180】

表1.11: この表は、199種の特定の式(T-1)の化合物を開示するものであり、式中、 n は2であり、 A^1 は $C - R^1$ であり、 A^2 は $C - R^2$ であり、 A^3 は $C - R^3$ であり、 A^4 は $C - R^4$ であり、ならびに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 は水素であり、ならびに、 R^7 は、表1において上記に定義されているとおりである。

【0181】

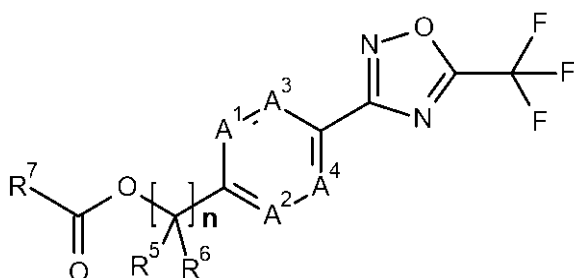
表1.12: この表は、199種の特定の式(T-1)の化合物を開示するものであり、式中、 n は2であり、 A^1 は $C - R^1$ であり、 A^2 は $C - R^2$ であり、 A^3 は $C - R^3$ であり、 A^4 は $C - R^4$ であり、ならびに、 R^1 、 R^2 、 R^4 、 R^5 および R^6 は水素であり、 R^3 はフッ素であり、ならびに、 R^7 は、表1において上記に定義されているとおりである。

30

【0182】

表2.1: この表は、117種の特定の式(T-2)の化合物を開示するものであり:

【化19】



(T-2)

40

式中、 n は1であり、 A^1 は $C - R^1$ であり、 A^2 は $C - R^2$ であり、 A^3 は $C - R^3$ であり、 A^4 は $C - R^4$ であり、ならびに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 は水素であり、ならびに、 R^7 は表2において以下に定義されているとおりである。

【0183】

表2.2 ~ 2.4の各々(表2に続く)は117種の個々の式(T-2)の化合物を提供するものであり、式中、 n 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6

50

は、 R^7 が特定の定義されている表2を参照する表2.2~2.4において特定の定義されているとおりである。

【0184】

表2

【表 2 - 1】

化合物 番号	R ⁷	化合物 番号	R ⁷
2.001	2-フルオロフェニル	2.060	4-ピリミジニル
2.002	3-フルオロフェニル	2.061	5-ピリミジニル
2.003	4-フルオロフェニル	2.062	2-チアゾリル
2.004	2-クロロフェニル	2.063	4-チアゾリル
2.005	3-クロロフェニル	2.064	5-チアゾリル
2.006	4-クロロフェニル	2.065	1H-イミダゾール-5-イル
2.007	2-メチルフェニル	2.066	2-メチル-1H-イミダゾール-5-イル
2.008	3-メチルフェニル	2.067	5-メチル-1H-イミダゾール-2-イル
2.009	4-メチルフェニル	2.068	1,2-ジメチルイミダゾール-5-イル
2.010	2-トリフルオロフェニル	2.069	1,5-ジメチルイミダゾール-2-イル
2.011	3-トリフルオロフェニル	2.070	オキサゾール-2-イル
2.012	4-トリフルオロフェニル	2.071	オキサゾール-4-イル
2.013	2-ジフルオロフェニル	2.072	オキサゾール-5-イル
2.014	3-ジフルオロフェニル	2.073	2-メチルオキサゾール-5-イル
2.015	4-ジフルオロフェニル	2.074	2-シアノオキサゾール-5-イル
2.016	2-メトキシフェニル	2.075	5-メチルオキサゾール-2-イル
2.017	3-メトキシフェニル	2.076	5-シアノオキサゾール-5-イル
2.018	4-メトキシフェニル	2.077	2-メチル-1,2,4-トリアゾール-3-イル
2.019	2-ジフルオロメトキシフェニル	2.078	オキセタン-3-イル
2.020	4-ジフルオロメトキシフェニル	2.079	チエタン-3-イル
2.021	3-ジフルオロメトキシフェニル	2.080	1H-アゼチジン-3-イル
2.022	2-ピリジル	2.081	1-アシル-アゼチジン-3-イル
2.023	3-ピリジル	2.082	テトラヒドロピラン-4-イル
2.024	4-ピリジル	2.083	4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル
2.025	6-クロロ-3-ピリジル	2.084	5,5-ジメチル-4H-イソキサゾール-3-イル
2.026	5-クロロ-3-ピリジル	2.085	4,4-ジメチル-4H-イソキサゾール-3-イル
2.027	4-クロロ-3-ピリジル	2.086	5-メチルイソキサゾール-3-イル
2.028	2-クロロ-3-ピリジル	2.087	1-メチルテトラゾール-5-イル
2.029	6-メチル-3-ピリジル	2.088	1H-ピラゾール-3-イル
2.030	5-メチル-3-ピリジル	2.089	1-メチルピラゾール-3-イル
2.031	4-メチル-3-ピリジル	2.090	1,5-ジメチルピラゾール-3-イル
2.032	2-メチル-3-ピリジル	2.091	1-アシルピラゾール-3-イル
2.033	6-シアノ-3-ピリジル	2.092	3,4-ジヒドロ-2H-ピロール-5-イル
2.034	5-シアノ-3-ピリジル	2.093	1H-ピロリジン-3-イル
2.035	4-シアノ-3-ピリジル	2.094	1-アシル-ピロリジン-4-イル
2.036	2-シアノ-3-ピリジル	2.095	テトラヒドロフラン-3-イル
2.037	6-フルオロ-4-ピリジル	2.096	2,3,4,5-テトラヒドロピリジン-6-イル

10

20

30

40

【表 2 - 2】

2.038	5-フルオロ-4-ピリジル	2.097	1-メトキシ-ピペリジン-4-イル
2.039	2-フルオロ-4-ピリジル	2.098	1H-ピペリジン-4-イル
2.040	6-クロロ-4-ピリジル	2.099	1-アシル-ピペリジン-4-イル
2.041	5-クロロ-4-ピリジル	2.100	シクロプロピル
2.042	6-トリフルオロメチル-2-ピリジル	2.101	シクロブチル
2.043	5-トリフルオロメチル-2-ピリジル	2.102	シクロペンチル
2.044	4-トリフルオロメチル-2-ピリジル	2.103	シクロヘキシル
2.045	3-トリフルオロメチル-2-ピリジル	2.104	シクロペンタ-3-エン-1-イル
2.046	6-ジフルオロメチル-2-ピリジル	2.105	シクロヘキサ-2-エン-1-イル
2.047	5-ジフルオロメチル-2-ピリジル	2.106	メチル
2.048	4-ジフルオロメチル-2-ピリジル	2.107	エチル
2.049	3-ジフルオロメチル-2-ピリジル	2.108	プロピル
2.050	6-ジフルオロメトキシ-2-ピリジル	2.109	イソプロピル
2.051	5-ジフルオロメトキシ-2-ピリジル	2.110	ブチル
2.052	4-ジフルオロメトキシ-2-ピリジル	2.111	ペンチル
2.053	3-ジフルオロメトキシ-2-ピリジル	2.112	プロプ-2-エン-1-イル
2.054	6-トリフルオロメチル-4-ピリジル	2.113	プロプ-2-イン-1-イル
2.055	5-トリフルオロメチル-4-ピリジル	2.114	2-メトキシエチル
2.056	2-トリフルオロメチル-4-ピリジル	2.115	2-エトキシエチル
2.057	6-ジフルオロメチル-4-ピリジル	2.116	2-イソプロピルオキシエチル
2.058	5-ジフルオロメチル-4-ピリジル	2.117	2-ジフルオロメトキシエチル
2.059	2-ジフルオロメチル-4-ピリジル		

10

20

30

40

【0185】

表 2 . 2 : この表は、117種の特定の式(T-2)の化合物を開示するものであり、式中、nは1であり、A¹はC-R¹であり、A²はC-R²であり、A³はC-R³であり、A⁴はC-R⁴であり、ならびに、R¹、R²、R⁴、R⁵およびR⁶は水素であり、R³はフッ素

50

であり、ならびに、 R^7 は、表2において上記に定義されているとおりである。

【0186】

表2.3：この表は、117種の特定の式(T-2)の化合物を開示するものであり、式中、 n は2であり、 A^1 はC-R¹であり、 A^2 はC-R²であり、 A^3 はC-R³であり、 A^4 はC-R⁴であり、ならびに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 は水素であり、ならびに、 R^7 は、表2において上記に定義されているとおりである。

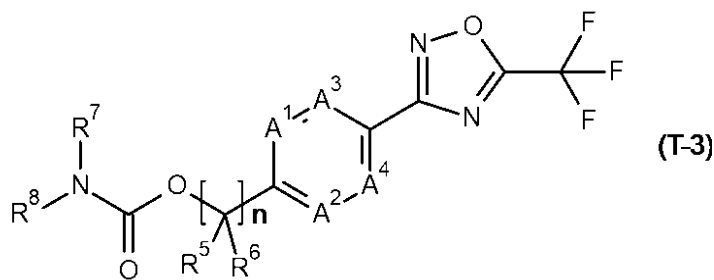
【0187】

表2.4：この表は、117種の特定の式(T-2)の化合物を開示するものであり、式中、 n は2であり、 A^1 はC-R¹であり、 A^2 はC-R²であり、 A^3 はC-R³であり、 A^4 はC-R⁴であり、ならびに、 R^1 、 R^2 、 R^4 、 R^5 および R^6 は水素であり、 R^3 はフッ素であり、ならびに、 R^7 は、表2において上記に定義されているとおりである。

10

【0188】

表3.1：この表は、122種の特定の式(T-3)の化合物を開示するものであり：
【化20】



20

式中、 n は1であり、 A^1 はC-R¹であり、 A^2 はC-R²であり、 A^3 はC-R³であり、 A^4 はC-R⁴であり、ならびに、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^8 は水素であり、ならびに、 R^7 は表3において以下に定義されているとおりである。

【0189】

表3.2~3.7の各々(表3に続く)は122種の個々の式(T-3)の化合物を提供するものであり、式中、 n 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^8 は、 R^7 が具体的に定義されている表3を参照する表3.2~3.7において具体的に定義されているとおりである。

30

【0190】

表3

【表 3 - 1】

化合物 番号	R ⁷	化合物 番号	R ⁷
3.001	2-フルオロフェニル	3.062	2-チアゾリル
3.002	3-フルオロフェニル	3.063	4-チアゾリル
3.003	4-フルオロフェニル	3.064	5-チアゾリル
3.004	2-クロロフェニル	3.065	1H-イミダゾール-5-イル
3.005	3-クロロフェニル	3.066	2-メチル-1H-イミダゾール-5-イル
3.006	4-クロロフェニル	3.067	5-メチル-1H-イミダゾール-2-イル
3.007	2-メチルフェニル	3.068	1,2-ジメチルイミダゾール-5-イル
3.008	3-メチルフェニル	3.069	1,5-ジメチルイミダゾール-2-イル
3.009	4-メチルフェニル	3.070	オキサゾール-2-イル
3.010	2-トリフルオロフェニル	3.071	オキサゾール-4-イル
3.011	3-トリフルオロフェニル	3.072	オキサゾール-5-イル
3.012	4-トリフルオロフェニル	3.073	2-メチルオキサゾール-5-イル
3.013	2-ジフルオロフェニル	3.074	2-シアノオキサゾール-5-イル
3.014	3-ジフルオロフェニル	3.075	5-メチルオキサゾール-2-イル
3.015	4-ジフルオロフェニル	3.076	5-シアノオキサゾール-5-イル
3.016	2-メトキシフェニル	3.077	2-メチル-1,2,4-トリアゾール-3-イル
3.017	3-メトキシフェニル	3.078	オキセタン-3-イル
3.018	4-メトキシフェニル	3.079	チエタン-3-イル
3.019	2-ジフルオロメトキシフェニル	3.080	1H-アゼチジン-3-イル
3.020	4-ジフルオロメトキシフェニル	3.081	1-アシル-アゼチジン-3-イル
3.021	3-ジフルオロメトキシフェニル	3.082	テトラヒドロピラン-4-イル
3.022	2-ピリジル	3.083	4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル
3.023	3-ピリジル	3.084	5,5-ジメチル-4H-イソキサゾール-3-イル
3.024	4-ピリジル	3.085	4,4-ジメチル-4H-イソキサゾール-3-イル
3.025	6-クロロ-3-ピリジル	3.086	5-メチルイソキサゾール-3-イル
3.026	5-クロロ-3-ピリジル	3.087	1-メチルテトラゾール-5-イル
3.027	4-クロロ-3-ピリジル	3.088	1H-ピラゾール-3-イル
3.028	2-クロロ-3-ピリジル	3.089	1-メチルピラゾール-3-イル
3.029	6-メチル-3-ピリジル	3.090	1,5-ジメチルピラゾール-3-イル
3.030	5-メチル-3-ピリジル	3.091	1-アシルピラゾール-3-イル
3.031	4-メチル-3-ピリジル	3.092	3,4-ジヒドロ-2H-ピロール-5-イル
3.032	2-メチル-3-ピリジル	3.093	1H-ピロリジン-3-イル
3.033	6-シアノ-3-ピリジル	3.094	1-アシル-ピロリジン-4-イル
3.034	5-シアノ-3-ピリジル	3.095	テトラヒドロフラン-3-イル
3.035	4-シアノ-3-ピリジル	3.096	2,3,4,5-テトラヒドロピリジン-6-イル
3.036	2-シアノ-3-ピリジル	3.097	1-メトキシ-ピペリジン-4-イル
3.037	6-フルオロ-4-ピリジル	3.098	1H-ピペリジン-4-イル
3.038	5-フルオロ-4-ピリジル	3.099	1-アシル-ピペリジン-4-イル
3.039	2-フルオロ-4-ピリジル	3.100	シクロプロピル

10

20

30

40

【表 3 - 2】

3.040	6-クロロ-4-ピリジル	3.101	シクロブチル
3.041	5-クロロ-4-ピリジル	3.102	シクロペンチル
3.042	6-トリフルオロメチル-2-ピリジル	3.103	シクロヘキシル
3.043	5-トリフルオロメチル-2-ピリジル	3.104	シクロペンタ-3-エン-1-イル
3.044	4-トリフルオロメチル-2-ピリジル	3.105	シクロヘキサ-2-エン-1-イル
3.045	3-トリフルオロメチル-2-ピリジル	3.106	メチル
3.046	6-ジフルオロメチル-2-ピリジル	3.107	エチル
3.047	5-ジフルオロメチル-2-ピリジル	3.108	プロピル
3.048	4-ジフルオロメチル-2-ピリジル	3.109	イソプロピル
3.049	3-ジフルオロメチル-2-ピリジル	3.110	ブチル
3.050	6-ジフルオロメトキシ-2-ピリジル	3.111	ペンチル
3.051	5-ジフルオロメトキシ-2-ピリジル	3.112	プロプ-2-エン-1-イル
3.052	4-ジフルオロメトキシ-2-ピリジル	3.113	プロプ-2-イン-1-イル
3.053	3-ジフルオロメトキシ-2-ピリジル	3.114	2-メトキシエチル
3.054	6-トリフルオロメチル-4-ピリジル	3.115	2-エトキシエチル
3.055	5-トリフルオロメチル-4-ピリジル	3.116	2-イソプロピルオキシエチル
3.056	2-トリフルオロメチル-4-ピリジル	3.117	2-ジフルオロメトキシエチル
3.057	6-ジフルオロメチル-4-ピリジル	3.118	2-クロロフェニル
3.058	5-ジフルオロメチル-4-ピリジル	3.119	メチルカルボニル
3.059	2-ジフルオロメチル-4-ピリジル	3.120	ピリジン-2-イル
3.060	4-ピリミジニル	3.121	(2-チエニル)メチル
3.061	5-ピリミジニル	3.122	2,2,2-トリフルオロエチル

10

20

30

40

【 0 1 9 1 】

表 3 . 2 : この表は、122種の特定の式(T-3)の化合物を開示するものであり、式中、nは1であり、A¹はC-R¹であり、A²はC-R²であり、A³はC-R³であり、A⁴はC-R⁴であり、ならびに、R¹、R²、R⁴、R⁵、R⁶およびR⁸は水素であり、R³はフッ素であり、ならびに、R⁷は、表3において上記に定義されているとおりである。

【 0 1 9 2 】

50

表 3 . 3 : この表は、1 2 2 種の特定の式 (T - 3) の化合物を開示するものであり、式中、n は 2 であり、A¹ は C - R¹ であり、A² は C - R² であり、A³ は C - R³ であり、A⁴ は C - R⁴ であり、ならびに、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ および R⁸ は水素であり、ならびに、R⁷ は、表 3 において上記に定義されているとおりである。

【 0 1 9 3 】

表 3 . 4 : この表は、1 2 2 種の特定の式 (T - 3) の化合物を開示するものであり、式中、n は 2 であり、A¹ は C - R¹ であり、A² は C - R² であり、A³ は C - R³ であり、A⁴ は C - R⁴ であり、ならびに、R¹、R²、R⁴、R⁵、R⁶ および R⁸ は水素であり、R³ はフッ素であり、ならびに、R⁷ は、表 3 において上記に定義されているとおりである。

【 0 1 9 4 】

表 3 . 5 : この表は、1 2 2 種の特定の式 (T - 3) の化合物を開示するものであり、式中、n は 1 であり、A¹ は C - R¹ であり、A² は C - R² であり、A³ は C - R³ であり、A⁴ は C - R⁴ であり、ならびに、R¹、R²、R⁴、R⁵ および R⁶ は水素であり、R⁸ はメトキシであり、ならびに、R⁷ は、表 3 において上記に定義されているとおりである。

【 0 1 9 5 】

表 3 . 6 : この表は、1 2 2 種の特定の式 (T - 3) の化合物を開示するものであり、式中、n は 1 であり、A¹ は C - R¹ であり、A² は C - R² であり、A³ は C - R³ であり、A⁴ は C - R⁴ であり、ならびに、R²、R²、R⁴、R⁵ および R⁶ は水素であり、R³ はフッ素であり、R⁸ はメトキシであり、ならびに、R⁷ は、表 3 において上記に定義されているとおりである。

【 0 1 9 6 】

表 3 . 7 : この表は、1 2 2 種の特定の式 (T - 3) の化合物を開示するものであり、式中、n は 1 であり、A¹ は C - R¹ であり、A² は C - R² であり、A³ は C - R³ であり、A⁴ は C - R⁴ であり、ならびに、R¹、R²、R⁴、R⁵ および R⁶ は水素であり、R⁸ はメチルであり、ならびに、R⁷ は、表 3 において上記に定義されているとおりである。

【 実施例 】

【 0 1 9 7 】

以下の実施例は本発明を例示するものである。本発明の化合物は低施用量でのより高い効力により公知の化合物とは区別可能であり、これは、実施例において概説されている実験手法を用い、必要に応じて、例えば 5 0 p p m、1 2 . 5 p p m、6 p p m、3 p p m、1 . 5 p p m、0 . 8 p p m または 0 . 2 p p m といったより少ない施用量を用いることで当業者によって検証が可能である。

【 0 1 9 8 】

式 (I) の化合物は、とりわけ、真菌によって引き起こされる病害に対する植物の保護に係る有利なレベルの生物学的活性、または、農芸化学活性成分としての使用に係る優れた特性 (例えば、高い生物学的活性、有利な活性スペクトル、高い安全性プロファイル (向上した作物耐性を含む)、向上した物理化学的特性、または、高い生分解性) を含む多数の有益性を有し得る。

【 0 1 9 9 】

本記載を通じて、温度は摂氏度 () で示されており、「m p .」は融点を意味する。L C / M S は液体クロマトグラフィ質量分析法を意味し、装置および方法 (方法 A、B および C) の説明は以下のとおりである。

【 0 2 0 0 】

L C / M S 装置および方法 A の説明は以下のとおりである。

W a t e r s 製 S Q D e t e c t o r 2

イオン化方法 : エレクトロスプレー

極性 : 陽イオンおよび陰イオン

キャピラリ (k V) 3 . 0、コーン (V) 3 0 . 0 0、抽出器 (V) 2 . 0 0、ソース温度 () 1 5 0、脱溶剤温度 () 3 5 0、コーンガス流 (L / H r) 0、脱溶剤ガス流 (L / H r) 6 5 0

10

20

30

40

50

質量範囲：100～900 Da

DAD波長範囲 (nm)：210～500

方法 以下のHPLC勾配条件を用いるWaters製ACQUITY UPLCによる

：
(溶剤A：水/メタノール20：1+0.05%ギ酸および溶剤B：アセトニトリル+0.05%ギ酸)

【0201】

【表4】

時間(分間)	A(%)	B(%)	流量(ml/min)
0	100	0	0.85
1.2	0	100	0.85
1.5	0	100	0.85

10

【0202】

カラムのタイプ：Waters製ACQUITY UPLC HSS T3；カラム長：30mm；カラムの内径：2.1mm；粒径：1.8ミクロン；温度：60。

【0203】

LC/MS装置および方法Bの説明は以下のとおりである。

Waters製SQ Detector 2

イオン化方法：エレクトロスプレー

極性：陽イオン

キャピラリ(kV)3.5、コーン(V)30.00、抽出器(V)3.00、ソース温度()150、脱溶剤温度()400、コーンガス流(L/Hr)60、脱溶剤ガス流(L/Hr)700

質量範囲：140～800 Da

DAD波長範囲 (nm)：210～400

方法 以下のHPLC勾配条件を用いるWaters製ACQUITY UPLCによる
(溶剤A：水/メタノール9：1+0.1%ギ酸および溶剤B：アセトニトリル+0.1%ギ酸)

【0204】

【表5】

時間(分間)	A(%)	B(%)	流量(ml/min)
0	100	0	0.75
2.5	0	100	0.75
2.8	0	100	0.75
3.0	100	0	0.75

30

【0205】

カラムのタイプ：Waters製ACQUITY UPLC HSS T3；カラム長：30mm；カラムの内径：2.1mm；粒径：1.8ミクロン；温度：60。

【0206】

LC/MS装置および方法Cの説明は以下のとおりである。

Waters製SQ Detector 2

イオン化方法：エレクトロスプレー

ACQUITY H Class UPLC、Waters製質量分光計

極性：陽および陰極性スイッチ

スキャンタイプMS1 Scan

キャピラリ(kV)3.00、コーン(V)40.00、脱溶剤温度()500、コー

40

50

ンガス流 (L / H r) 5 0、脱溶剤ガス流 (L / H r) 1 0 0 0

質量範囲：0 ~ 2 0 0 0 D a

D A D 波長範囲 (n m) : 2 0 0 ~ 3 5 0

方法 以下の H P L C 勾配条件を用いる W a t e r s 製 A C Q U I T Y U P L C による
(溶剤 A : 水 + 0 . 1 % ギ酸および溶剤 B : アセトニトリル)

【 0 2 0 7 】

【表 6】

時間(分間)	A(%)	B(%)	流量(ml/min)
0	70	30	0.5
0.05	70	30	0.5
0.8	5	95	0.5
1.8	5	95	0.5
2.45	70	30	0.5
2.50	70	30	0.5

10

【 0 2 0 8 】

カラムのタイプ：W a t e r s 製 A C Q U I T Y U P L C B E H C 1 8 ; カラム
長：5 0 m m ; カラムの内径：2 . 1 m m ; 粒径：1 . 7 ミクロン ; 温度：3 5 。

【 0 2 0 9 】

必要に応じて、鏡像異性的に純粋な最終化合物が、適宜、逆相キラルクロマトグラフィ
などの標準的な物理的分離技術によって、または例えば、キラル出発材料を用いること
による立体選択的合成技術によって、ラセミ材料から得られる。

20

【 0 2 1 0 】

配合物実施例

【 0 2 1 1 】

【表 7】

水和剤	a)	b)	c)
活性成分[式(I)の化合物]	25 %	50 %	75 %
リグノスルホン酸ナトリウム	5 %	5 %	—
ラウリル硫酸ナトリウム	3 %	—	5 %
ナトリウムジイソブチルナフタレンスルホネート	—	6 %	10 %
フェノールポリエチレングリコールエーテル (7~8 molのエチレンオキシド)	—	2 %	—
高分散ケイ酸	5 %	10 %	10 %
カオリン	62 %	27 %	—

30

【 0 2 1 2 】

活性成分を補助剤と十分に混合すると共に混合物を好適なミルで十分に粉碎して、水で
希釈された所望の濃度の懸濁液をもたらすことが可能である水和剤を得た。

40

【 0 2 1 3 】

【表 8】

乾燥種子処理に係る粉末	a)	b)	c)
活性成分[式(I)の化合物]	25 %	50 %	75 %
軽質鉱油	5 %	5 %	5 %
高分散ケイ酸	5 %	5 %	—
カオリン	65 %	40 %	—
タルカム	—	—	20 %

【0214】

10

活性成分を補助剤と十分に混合すると共に混合物を好適なミルで十分に粉砕して、種子処理に直接用いることが可能である粉末を得た。

【0215】

乳化性濃縮物

活性成分 [式 (I) の化合物]	10 %
オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル (4 ~ 5 mol のエチレンオキシド)	3 %
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	3 %
ヒマシ油ポリグリコールエーテル (35 mol のエチレンオキシド)	4 %
シクロヘキサノン	30 %
キシレン混合物	50 %

20

【0216】

植物の保護において用いられることが可能である、任意の必要とされる希釈率のエマルジョンを、この濃縮物から水による希釈で得ることが可能である。

【0217】

【表 9】

粉剤	a)	b)	c)
活性成分[式(I)の化合物]	5 %	6 %	4 %
タルカム	95 %	—	—
カオリン	—	94 %	—
無機充填材	—	—	96%

30

【0218】

すぐに使用可能な粉剤は、活性成分とキャリアとを混合し、この混合物を好適なミルで粉砕することにより得られる。このような粉末は、種子の乾燥粉衣に用いられることも可能である。

【0219】

押し出し顆粒

活性成分 [式 (I) の化合物]	15 %
リグノスルホン酸ナトリウム	2 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
カオリン	82 %

40

【0220】

活性成分を補助剤と混合および粉砕し、この混合物を水で湿らせる。この混合物を押し出し、次いで、空気流中で乾燥させる。

【0221】

コーティングされた顆粒

活性成分 [式 (I) の化合物]	8 %
ポリエチレングリコール (mol . wt . 200)	3 %

50

カオリン 89%

【0222】

細かく粉碎した活性成分を、ミキサ中において、ポリエチレングリコールで湿らせたカオリンに均一に適用する。粉末を発生しないコーティングされた顆粒がこのようにして得られる。

【0223】

懸濁液濃縮物

活性成分 [式 (I) の化合物]	40%	
プロピレングリコール	10%	
ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル (15 mol のエチレンオキシド)	6%	10
リグノスルホン酸ナトリウム	10%	
カルボキシメチルセルロース	1%	
シリコーン油 (75% 水中エマルジョンの形態)	1%	
水	32%	

【0224】

細かく粉碎した活性成分を補助剤と均質に混合して懸濁液濃縮物を得、水で希釈することによって、この懸濁液を任意の所望の濃度で得ることが可能である。このような希釈を用いることで、吹付け、注ぎかけ、または、浸漬により、微生物による外寄生から、生存している植物ならびに植物繁殖体を処理および保護可能である。

20

【0225】

種子処理に係る流動性濃縮物

活性成分 [式 (I) の化合物]	40%	
プロピレングリコール	5%	
コポリマーブタノール PO/EO	2%	
10 ~ 20 モルの EO を伴うトリスチレンフェノール	2%	
1, 2 - ベンズイソチアゾリン - 3 - オン (20% 水溶液の形態)	0.5%	
モノアゾ - 顔料カルシウム塩	5%	
シリコーン油 (75% 水中エマルジョンの形態)	0.2%	
水	45.3%	30

30

【0226】

細かく粉碎した活性成分を補助剤と均質に混合して懸濁液濃縮物を得、水で希釈することによって、この懸濁液を任意の所望の濃度で得ることが可能である。このような希釈を用いることで、吹付け、注ぎかけ、または、浸漬により、微生物による外寄生から、生存している植物ならびに植物繁殖体を処理および保護可能である。

【0227】

緩効性カプセル懸濁液

28部の組み合わせた式 (I) の化合物を、2部の芳香族溶剤および7部のトルエンジイソシアネート / ポリメチレン - ポリフェニルイソシアネート混合物 (8 : 1) と混合する。この混合物を、1.2部のポリビニルアルコール、0.05部の脱泡剤および51.6部の水の混合物中において、所望の粒径が達成されるまで乳化させる。このエマルジョンに、5.3部の水中の2.8部の1, 6 - ジアミノヘキサンの混合物を添加する。この混合物を、重合反応が完了するまで攪拌する。

40

【0228】

得られるカプセル懸濁液を、0.25部の増粘剤および3部の分散剤を添加することにより安定化させる。カプセル懸濁液配合物は、28%の活性成分を含有する。中程度のカプセル径は8 ~ 15ミクロンである。

【0229】

得られる配合物を、目的に好適な装置中において、水性懸濁液として種子に適用する。

【0230】

50

略語のリスト：

A I B N = アゾビスイソブチロニトリル

b r s = 幅広の一重項

C D C l₃ = クロロホルム - d
= 摂氏度

D I P E A = N , N - ジ - イソプロピルエチルアミン

d = 二重項

E t O A c = 酢酸エチル

h = 時間

H C l = 塩酸

N B S = N - プロモスクシンイミド

M = モル濃度

m i n = 分間

M H z = メガヘルツ

m p = 融点

N = ノルマル

p p m = 百万分率

R_t = 保持時間

R T = 室温

s = 一重項

t = 三重項

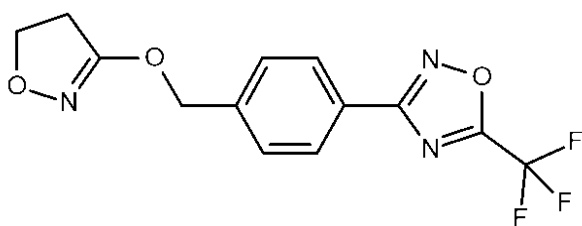
T F A A = トリフルオロ酢酸無水物

L C / M S = 液体クロマトグラフィ質量分析法 (L C / M S 分析に用いた装置および方法の説明は上記のとおりである)

【 0 2 3 1 】

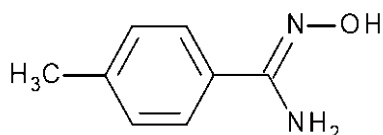
実施例 1 : この実施例は、3 - [4 - (4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イルオキシメチル) フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール (表 T 1 の化合物 1 . 2) の調製を例示する。

【 化 2 1 】



ステップ 1 : N' - ヒドロキシ - 4 - メチル - ベンズアミジンの調製

【 化 2 2 】



R T の 4 - メチルベンゾニトリル (3 5 g 、 0 . 2 9 m o l) のエタノール (2 2 0 m L) および水 (4 4 0 m L) 中の懸濁液に、塩酸ヒドロキシルアミン (4 1 . 1 g 、 0 . 5 8 m o l) 、炭酸カリウム (6 5 . 4 g 、 0 . 4 7 m o l) および 8 - ヒドロキシキノリン (0 . 2 2 g 、 1 . 5 m m o l) を添加した。この反応混合物を 8 0 ° で 4 時間加熱した。この混合物を R T に冷却し、2 N H C l で p H 8 となるまで希釈し、エタノールを減圧下で除去した。得られた混合物をろ過し、水で洗浄し、減圧下で乾燥させて表題の化合物を得、これをさらに精製せずに用いた。L C / M S (方法 A) 保持時間 = 0 . 2 3

10

20

30

40

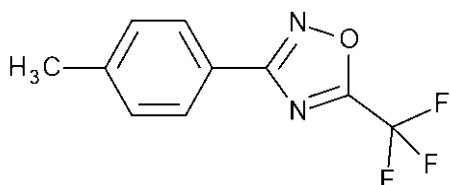
50

分、151.0 (M + H)。

【0232】

ステップ2: 3 - (p - トリル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾールの調製

【化23】



10

N' - ヒドロキシ - 4 - メチル - ベンズアミジン (38.7 g、0.25 mol) の 2 - メチルテトラヒドロフラン (750 mL) 中の攪拌溶液に、TFAA (49 mL、0.35 mol) を 0 で添加した。この反応混合物を 2 時間、15 で攪拌し、次いで、水で希釈した。有機層を分離し、重炭酸ナトリウム溶液、飽和塩化アンモニウム水溶液、次いで、水で順次に洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、乾燥するまで蒸発させた。粗生成物を、ヘプタン / EtOAc 99 : 1 ~ 90 : 10 を伴うシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィ (750 g の予め充填されたカラム) に供して、表題の化合物を清透な油として得たが、これは、保管後に固化した。LC / MS (方法 A) 保持時間 = 1.15 分、質量は検出されなかった。

20

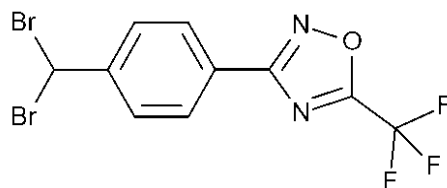
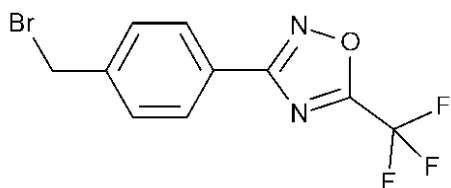
^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm : 8.00 (d, 2H), 7.32 (d, 2H), 2.45 (s, 3H) .

^{19}F NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm : -65.41 (s) .

【0233】

ステップ3a: 3 - [4 - (ブロモメチル)フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾールの調製

【化24】



30

3 - (p - トリル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール (56.0 g、0.24 mol) および NBS (45.4 g、0.25 mol) のテトラクロロメタン (480 mL) 中の攪拌した混合物を、アルゴン雰囲気下で、70 に加熱した。AIBN (4.03 g、24 mmol) を添加し、この反応混合物を 65 で 18 時間攪拌した。この混合物を RT に冷却し、ジクロロメタンおよび水で希釈し、層を分離した。有機層を重炭酸ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、乾燥するまで蒸発させた。粗残渣を、シクロヘキサン / EtOAc 100 : 0 ~ 95 : 5 を伴うシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィ (750 g の予め充填されたカラム) に供して、表題の化合物を白色の固体 (44.7 g、57% 収率) として得た。mp : 58 ~ 63 。LC / MS (方法 A) 保持時間 = 1.16 分、308 (M + H)。

40

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm : 8.11 (d, 2H), 7.55 (d, 2H), 4.53 (s, 2H) .

^{19}F NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm : -65.32 (s) .

【0234】

3 - [4 - (ジブロモメチル)フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾールを、白色の固体 (1.7 g、1.5% 収率) の副生成物として単離した。mp : 61 ~ 66 。

50

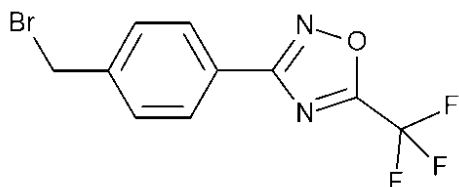
^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm: 8.15 (d, 2H), 7.73 (d, 2H), 6.68 (s, 1H).

^{19}F NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm: -65.34 (s).

【0235】

ステップ3b: 3-[4-(ジブロモメチル)フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾールからの3-[4-(プロモメチル)フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾールの調製

【化25】



10

3-[4-(プロモメチル)フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾールおよび3-[4-(ジブロモメチル)フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール(10.2g)のアセトニトリル(95mL)、水(1.9mL)およびDIPEA(6.20mL、35.7mmol)中の撹拌した1:9比の混合物に、ジエチルホスファイト(4.7mL、35.7mmol)を5で添加した。この混合物を2時間、5~10で撹拌し、次いで、水および1M HClを添加した。揮発物を減圧下で除去し、得られた白色のスラリーをジクロロメタンで3回抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過した。溶剤を減圧下で除去し、粗残渣を、シクロヘキサン/EtOAc 99:1~9:1を伴うシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィ(40gの予め充填されたカラム)に供して、3-[4-(プロモメチル)フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾールを白色の固体(7.1g、95%収率)として得た。mp: 58~63。LC/MS(方法A)保持時間=1.16分、308(M+H)。

20

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm: 8.11 (d, 2H), 7.55 (d, 2H), 4.53 (s, 2H).

^{19}F NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm: -65.32 (s).

30

【0236】

ステップ4: 3-[4-(4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イルオキシメチル)フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾールの調製

3-[4-(プロモメチル)フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール(150mg、0.46mmol)、イソキサゾリジン-3-オン(61mg、0.7mmol)および炭酸カリウム(130mg、0.93mmol)のアセトニトリル(4.7mL)中の不均一溶液に、マイクロ波を120で、30分間照射した。次いで、固形分をろ過により除去し、酢酸エチルで洗浄し、母液を減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィ(シクロヘキサン/EtOAc 溶離液勾配1:0~1:1)により精製して、表題の化合物を黄色の固体(19mg、13%収率)として得た。LC/MS(方法A)保持時間=0.96分、314(M+H)。mp: 97.0~101

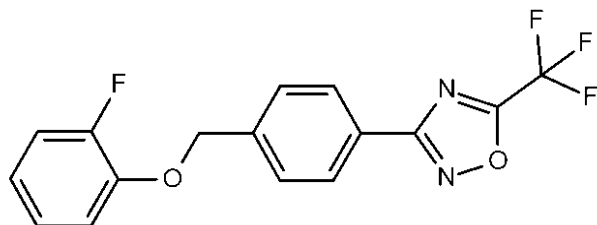
40

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm: 8.10 (d, 2H), 7.48 (d, 2H), 4.75 (s, 2H), 4.34 (t, 2H), 2.84 (t, 2H)

【0237】

実施例2: この実施例は、3-[4-[(2-フルオロフェノキシ)メチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール(表T1の化合物1.1)の調製を例示する。

【化 2 6】



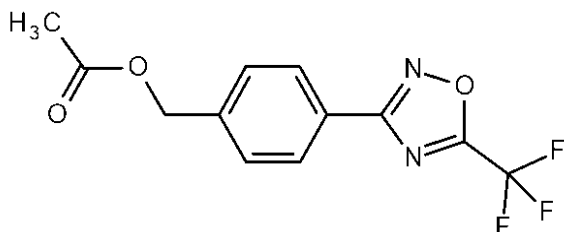
2 - フルオロフェノール (0 . 1 7 g , 1 . 5 m m o l) のアセトニトリル (1 0 m L) 中の溶液に、炭酸カリウム (0 . 2 7 5 g , 1 . 9 9 m m o l) および 3 - [4 - (ブロモメチル) フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール (0 . 3 1 g , 0 . 1 0 m m o l) を添加し、この反応混合物を室温で一晩攪拌した。この反応塊を水で希釈し、得られた水溶液を酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機層を水および塩水で洗浄し、次いで、硫酸ナトリウムで乾燥させた。揮発物を減圧下で除去し、粗塊を、シリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィ (シクロヘキサン / E t O A c 溶離液勾配) を用いて精製して、表題の化合物 (3 0 2 m g , 9 0 % 収率) を白色の固体として得た。LC / MS (方法 A) 保持時間 = 1 . 0 8 分、3 3 7 (M - H) 。 mp : 1 0 8 ~ 1 1 0 。

^1H NMR (4 0 0 M H z , C D C l ₃) ppm : 8 . 1 6 (m , 2 H) , 7 . 6 4 (d , 2 H) , 7 . 0 5 (m , 4 H) , 5 . 2 5 (s , 2 H) 。

【 0 2 3 8 】

実施例 3 : この実施例は、[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] 酢酸メチル (表 T 2 の化合物 2 . 1) の調製を例示する。

【化 2 7】



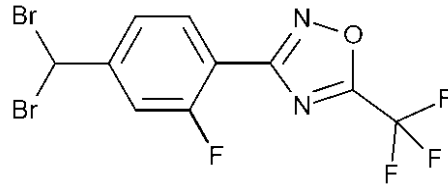
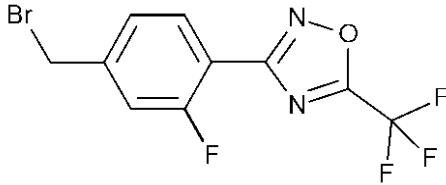
3 - [4 - (ブロモメチル) フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール (1 . 2 g , 4 . 0 m m o l) のジメチルホルムアミド (1 0 m L) 中の溶液に酢酸カリウム (1 . 0 6 g , 5 . 9 8 m m o l) を添加し、この反応混合物を一晩攪拌した。水を導入し、層を分離し、水性層を酢酸エチルで抽出した。溶剤を減圧下で除去し、得られた粗残渣をシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィ (シクロヘキサン / E t O A c 溶離液勾配 1 : 0 ~ 1 5 : 1) により精製して、表題の化合物を清透な油 (1 . 1 4 g , 9 2 % 収率) として得た。LC / MS (方法 A) 保持時間 = 0 . 9 4 分、2 8 5 (M - H) 。

^1H NMR (4 0 0 M H z , C D C l ₃) ppm : 8 . 0 5 (d , 2 H) , 7 . 4 4 (d , 2 H) , 5 . 1 0 (s , 2 H) , 2 . 0 7 (t , 3 H) 。

【 0 2 3 9 】

実施例 4 : この実施例は、3 - [4 - (4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イルオキシメチル) - 2 - フルオロ - フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール (表 T 1 の化合物 1 . 1 3) の調製を例示する。

【化31】



アルゴン下で、テトラクロロメタン (34.3 mL) 中の 3-(2-フルオロ-4-メチル-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール (4.2 g、17.1 mmol) および NBS (3.11 g、17.1 mmol) の攪拌混合物を、70 に加熱した。AIBN (0.29 g、1.71 mmol) を添加し、反応混合物を 65 で 18 時間攪拌した。混合物を 25 に冷却し、次いで、ジクロロメタンおよび水で希釈し、その後、層を分離した。スクシンイミド副生成物をろ過して取り出し、溶媒を減圧下で除去して、褐色のガムを得た。この粗残渣を、(シクロヘキサン/EtOAc 100:0~4:1) を用いたシリカゲル上でのフラッシュクロマトグラフィに供して、表題化合物を白色の固体 (1.7 g、31% の収率として) 得た。LC/MS (方法 A) 保持時間 = 1.13 分、(M+H) 非検出。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm: 8.09 (t, 1H)、7.34 (m, 2H)、4.49 (s, 2H)。

^{19}F NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm: -65.18 (s)、-106.2 (s)。

【0242】

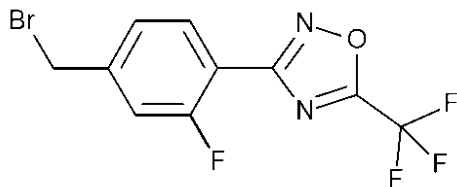
3-[4-(ジプロモメチル)フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾールを、ベージュ色の固体 (4.0 g、58% の収率) の形態の副生成物として単離した。LC/MS (方法 A) 保持時間 = 1.20 分、(M+H) 非検出。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm: 8.14 (d, 1H)、7.52 (dd, 2H)、6.63 (s, 1H)。

【0243】

ステップ 3b: 33-[4-(ジプロモメチル)-2-フルオロ-フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾールからの 3-[4-(プロモメチル)-2-フルオロ-フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾールの調製

【化32】



5 で、アセトニトリル (37 mL)、水 (0.8 mL) および DIPEA (2.59 mL、14.8 mmol) 中の、3-[4-(プロモメチル)-2-フルオロ-フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾールと、3-[4-(ジプロモメチル)-2-フルオロ-フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール (4.0 g、9.9 mmol) との 1:20 の比率の混合物に、垂リン酸ジエチル (2.0 mL、14.8 mmol) を添加した。混合物を 5~10 で 2 時間攪拌し、水および 1 M の HCl を添加し、揮発性物質を減圧下で除去した。白色のスラリーをジクロロメタンで 3 回抽出し、組み合わされた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過した。溶媒を減圧下で除去し、得られた薄いオレンジ色の粗残渣を、シクロヘキサン/EtOAc 99:1~1:1 を用いたシリカゲル上でのフラッシュクロマトグラフィに供して、3-[4-(プロモメチル)-2-フルオロ-フェニル]-5-(トリフルオロ

メチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール (2.2 g、68%の収率) を得た。LC / MS (方法 A) 保持時間 = 1.13 分、(M + H) 非検出。

^1H NMR (400 MHz、 CDCl_3) ppm: 8.09 (t, 1H)、7.34 (m, 2H)、4.49 (s, 2H)。

^{19}F NMR (400 MHz、 CDCl_3) ppm: -65.18 (s)、-106.2 (s)。

【0244】

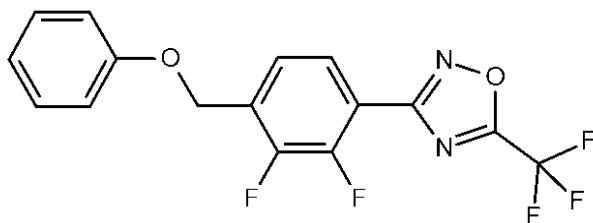
ステップ 4: 3 - [4 - (4, 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イルオキシメチル) - 2 - フルオロ - フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾールの調製

3 - [4 - (プロモメチル) - 2 - フルオロフェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール (100 mg、0.31 mmol)、イソキサゾリジン - 3 - オン (41 mg、0.45 mmol) および炭酸カリウム (95 mg、0.93 mmol) のアセトニトリル (3.6 mL) 中の溶液に、マイクロ波を 120 で、30 分間照射した。次いで、固形分をろ過により除去し、酢酸エチルで洗浄し、母液を減圧下で濃縮した。得られた残渣をシリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィ (シクロヘキサン / EtOAc 溶離液勾配 1:0 ~ 1:1) により精製して、表題の化合物を黄色の固体 (7 mg、7% 収率) として得た。LC / MS (方法 A) 保持時間 = 1.04 分、332 (M + H)。

【0245】

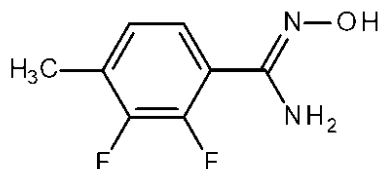
実施例 5: この実施例は、3 - [2, 3 - ジフルオロ - 4 - (フェノキシメチル) フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール (表 T1 の化合物 1.12) の調製を例示する。

【化 33】



ステップ 1: 2, 3 - ジフルオロ - N' - ヒドロキシ - 4 - メチル - ベンズアミジンの調製

【化 34】



25 で、エタノール (111 mL) 中の 2, 3 - ジフルオロ - 4 - メチルベンゾニトリル (5.0 g、32.6 mmol) の懸濁液に、ヒドロキシルアミン塩酸塩 (4.5 g、65.3 mmol) を添加した。反応混合物を 80 で 2 時間加熱した。RT に冷却した後、揮発性物質を、減圧下で除去することで、白色の固体を得て、これを精製せずに次のステップに使用した。

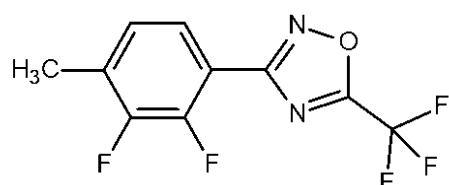
^1H NMR (400 MHz、 CDCl_3) ppm: 7.30 (m, 1H)、6.95 (m, 1H)、6.50 (brs, 1H)、5.05 (brs, 2H)、2.30 (s, 3H)。

【0246】

ステップ 2: 3 - (2, 3 - ジフルオロ - 4 - メチル - フェニル) - 5 - (トリフルオロ

メチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾールの調製

【化35】



氷浴を用いて冷却したテトラヒドロフラン (108 mL) 中の 2, 3 - ジフルオロ - N
 ' - ヒドロキシ - 4 - メチル - ベンズアミジン (2.6 mmol) の溶液に、TFAA (10
 6.9 mL、49 mmol) を添加した。反応混合物を 25 で一晩攪拌し、次いで、水
 で希釈した。有機層を分離し、炭酸水素ナトリウム溶液、塩化アンモニウム溶液、および
 水で連続して洗浄し、次いで、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、蒸発乾固させた。粗
 製の表題化合物 (6.6 g、72% の収率) を淡褐色の固体として単離して、これをさら
 に精製せずに次の変換に使用した。LC/MS (方法 A) 保持時間 = 1.16 分、265
 (M + H)。

10

^1H NMR (400 MHz、 CDCl_3) ppm: 7.76 (d, 1H)、7.12 (d, 1H)、2.41 (s, 3H)。

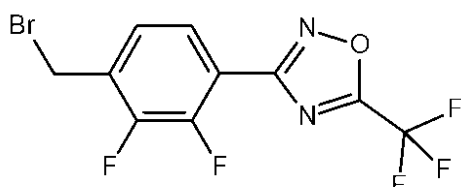
^{19}F NMR (400 MHz、 CDCl_3) ppm: -65.41 (s)、-133.3 (s)、-140.1 (s)。

20

【0247】

ステップ 3: 3 - [4 - (プロモメチル) - 2, 3 - ジフルオロ - フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾールの調製

【化36】



30

アルゴン下で、テトラクロロメタン (79 mL) 中の、3 - (2, 3 - ジフルオロ - 4
 - メチル - フェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール (6.0 g、22.6 mmol) と、NBS (7.17 g、10.0 mmol) との混合物
 を、70 に加熱した。AIBN (0.68 g、3.95 mmol) を添加し、反応混合物
 を 65 で 36 時間攪拌した。混合物を 25 に冷却し、ジクロロメタンおよび水で希
 釈し、層を分離した。スクシンイミド副生成物をろ過して取り出し、溶媒を減圧下で除去
 して、褐色のガムを得た。この粗残渣を、シリカゲル上でのフラッシュクロマトグラフィ
 (シクロヘキサン / EtOAc 溶離剤勾配 100 : 0 ~ 4 : 1) に供して、表題化合物を
 白色の固体 (4.8 g、72% の収率) として得た。LC/MS (方法 A) 保持時間 = 1
 .16 分、344 (M + H)。

40

^1H NMR (400 MHz、 CDCl_3) ppm: 7.80 (m, 1H)、7.37 (m, 1H)、4.55 (s, 2H)。

^{19}F NMR (400 MHz、 CDCl_3) ppm: -65.1 (s)、-131.2 (s)、-139.1 (s)。

【0248】

ステップ 4: 3 - [2, 3 - ジフルオロ - 4 - (フェノキシメチル) フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾールの調製

フェノール (0.03 g、0.33 mmol) のアセトニトリル (5 mL) 中の溶液に
 、炭酸カリウム (0.06 g、0.44 mmol)、次いで、3 - [4 - (プロモメチル)
) - 2, 3 - ジフルオロ - フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキ

50

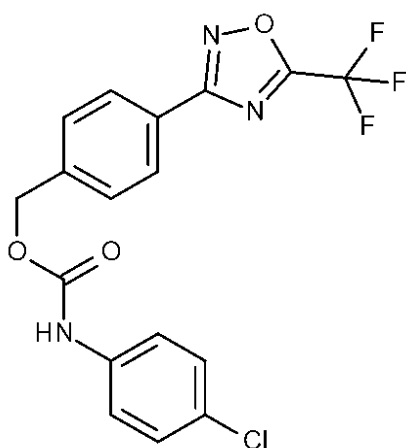
サジアゾール (75 mg、0.22 mmol) を添加し、反応混合物を RT で一晩撹拌した。この反応混合物を水で希釈し、得られた水溶液を EtOAc で抽出した。組み合わせた有機層を水、続いて、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗塊を、シリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィ (シクロヘキサン / EtOAc 溶離液勾配) に供して、表題の化合物 (50 mg、64% 収率) を白色の固体として得た。LC / MS (方法 A) 保持時間 = 1.09 分、355 (M + H)。mp : 113 ~ 115

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm : 7.90 (m, 1H), 7.52 (t, 1H), 7.35 (t, 2H), 7.03 (m, 3H), 5.26 (s, 2H) .

【0249】

実施例 6 : この実施例は、[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 N - (4 - クロロフェニル)カルバメート (表 T 3 の化合物 3.10) の調製を例示する。

【化 37】



[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]メタノール (0.08 g、0.3 mmol) のジクロロメタン (2 mL) 中の溶液に、ピリジン (0.08 g、1.0 mmol) および 1 - クロロ - 4 - イソシアナト - ベンゼン (0.05 g、0.3 mmol) を添加した。この反応混合物を 40 で 12 時間撹拌した。次いで、この反応混合物を周囲温度に冷却し、水 (10 mL) 中に注ぎ入れ、ジクロロメタンで 2 回抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過した。溶剤を減圧下で除去し、得られた粗残渣を、シリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィ (ヘプタン : EtOAc 溶離液勾配 9 : 1 ~ 8 : 2) に供して、表題の化合物 (0.075 g) を白色の固体として得た。LC / MS (方法 A) 保持時間 = 1.629 分、395.6 (M - H)。

^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) ppm : 10.02 (brs, 1H), 8.09 (m, 2H), 7.65 (d, 2H), 7.49 (d, 2H), 7.34 (d, 2H), 5.26 (s, 2H) .

^{19}F NMR (376 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) ppm : -64.74 (s)

【0250】

実施例 7 : この実施例は、[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 N - シクロプロピルカルバメート (表 T 3 の化合物 3.2) の調製を例示する。

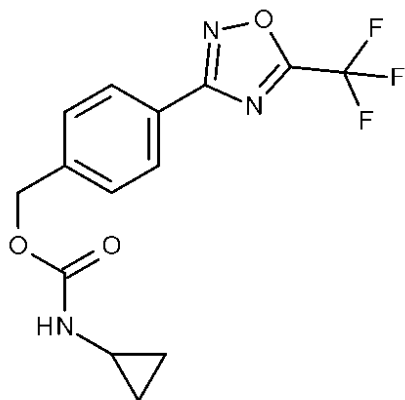
10

20

30

40

【化 3 8】



10

シクロプロパンアミン (0.03 g、0.5 mmol) のジクロロメタン (2 mL) 中の溶液に、ビス(トリクロロメチル)カーボネート (0.05 g、0.2 mmol) を添加し、周囲温度で撹拌した。30分後、ピリジン (0.04 g、0.5 mmol) および [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]メタノール (0.1 g、0.4 mmol) をこの反応塊に添加し、この反応混合物を周囲温度でさらに12時間撹拌した。この反応混合物を周囲温度に冷却し、水中に注ぎ入れ、ジクロロメタンで抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過した。溶剤を減圧下で除去し、得られた粗残渣を、シリカゲルによるフラッシュクロマトグラフィ (ヘプタン: EtOAc 溶離液勾配 9:1 ~ 8:2) に供して、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 N-シクロプロピルカルバメート (0.03 g、理論収量の20%収率) をオフホワイトの固体として得た。

20

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm: 8.04 (d, 2H), 7.44 (d, 2H), 5.11 (s, 2H), 4.93 (brs, 1H), 2.56 (m, 1H), 0.68 (m, 2H), 0.48 (m, 2H).

【0251】

表T1: 式(1)の化合物に係る融点(mp)データおよび/または保持時間(Rt):

30

【表 10 - 1】

項目	化合物名	構造	R_f (分)	質量 電荷 (M+H) ⁺	方法	mp (°C)
1.1	3-[4-[(4,4-ジメチル-5H-イソキサゾール-3-イル)オキシメチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					50.2 - 51.8
1.2	3-[4-(4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イル)オキシメチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					97 - 100.9
1.3	3-[4-[(5,5-ジメチル-4H-イソキサゾール-3-イル)オキシメチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					107.9 - 108.6
1.4	3-[4-(イソキサゾール-3-イル)オキシメチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					61.8 - 64.4
1.5	3-[4-[(5-メチルイソキサゾール-3-イル)オキシメチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					81.2 - 82.6
1.6	3-[4-[(4-フルオロフェノキシ)メチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					174 - 176
1.7	3-[4-(フェノキシ)メチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					105 - 107

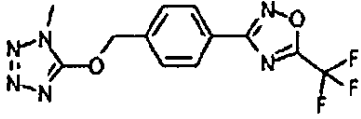
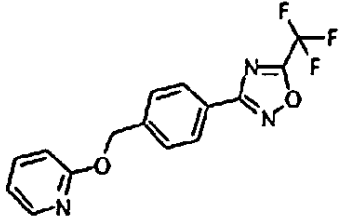
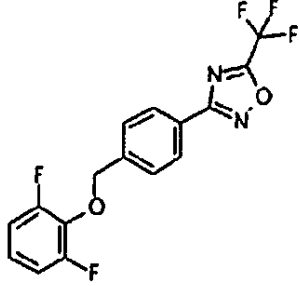
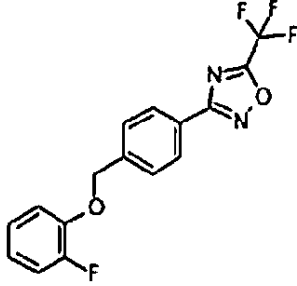
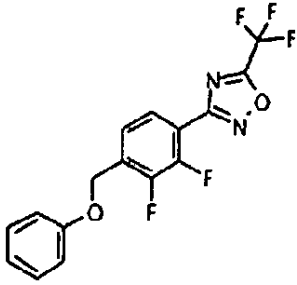
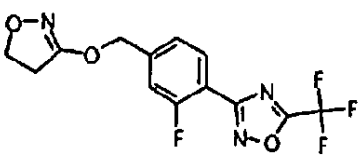
10

20

30

40

【表 10 - 2】

1.8	3-[4-[(1-メチルテトラゾール-5-イル)オキシメチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					113.3 - 114.2
1.9	3-[4-(2-ピリジルオキシメチル)フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					86 - 88
1.10	3-[4-[(2,6-ジフルオロフェノキシ)メチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					66 - 68
1.11	3-[4-[(2-フルオロフェノキシ)メチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					108 - 110
1.12	3-[2,3-ジフルオロ-4-(フェノキシメチル)フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					113 - 115
1.13	3-[4-(4,5-ジヒドロイソキサゾール-3-イルオキシメチル)-2-フルオロフェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール		1.04	332		

10

20

30

40

【表 10 - 3】

1.14	6-[[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]メトキシ]ピリジン-3-カルボニトリル					156 - 158
1.15	3-[4-[(5-メチル-2-ピリジル)オキシメチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					141 - 143
1.16	3-[4-[(5-フルオロ-2-ピリジル)オキシメチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					84 - 86
1.17	3-[4-[(1-メチルピラゾール-3-イル)オキシメチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					84.9 - 87.8
1.18	1-[3-[[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]メトキシ]ピラゾール-1-イル]エタノン					86.1 - 87.3
1.19	3-[4-[(5-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)オキシメチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					137.4 - 141.8
1.20	2-メチル-5-[[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]メトキシ]-1,3,4-オキサジアゾール					

10

20

30

40

【表 10 - 4】

1.21	3-[4-[(6-プロモピリダジン-3-イル)オキシメチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					
1.22	3-[4-[1-(1-メチルテトラゾール-5-イル)オキシエチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					104 - 106
1.23	[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 N-メトキシメタンイミデート					
1.24	3-[4-[1-[(6-メチル-2-ピリジル)オキシ]エチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					
1.25	3-[2,6-ジフルオロ-4-[(6-メチル-2-ピリジル)オキシメチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					64 - 66
1.26	3-[4-[(5,5-ジメチル-4H-イソキサゾール-3-イル)オキシメチル]-2,6-ジフルオロフェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール		1.05	378.3		
1.27	3-[2,5-ジフルオロ-4-[(6-メチル-2-ピリジル)オキシメチル]フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール					91 - 94

10

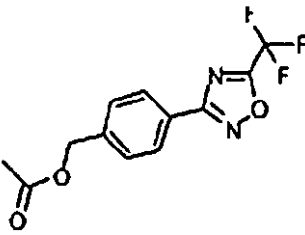
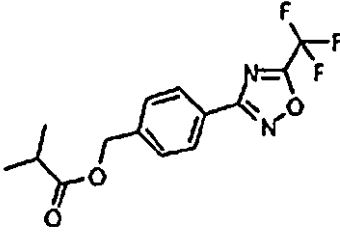
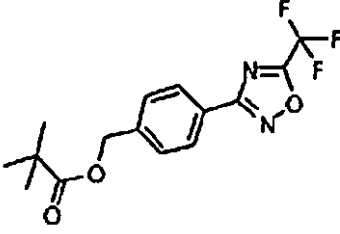
20

30

40

表T2: 式(1)の化合物に係る融点(mp)データおよび/または保持時間(Rt):

【表 1 1】

項目	化合物名	構造	R _t (分)	質量電荷 (M+H) +	方法	mp (°C)
2.1	[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]酢酸メチル		1.04	285 (M-H)	C	
2.2	[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 2-メチルプロパノエート					48 - 50
2.3	[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 2,2-ジメチルプロパノエート		1.09	327 (M-H)	C	

10

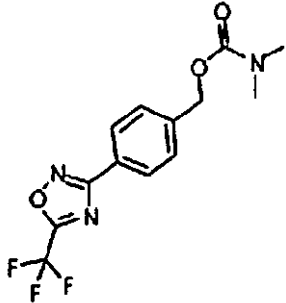
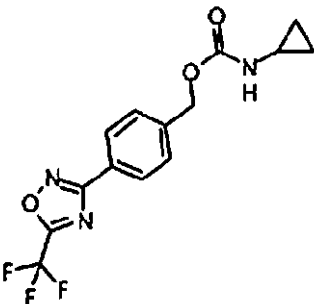
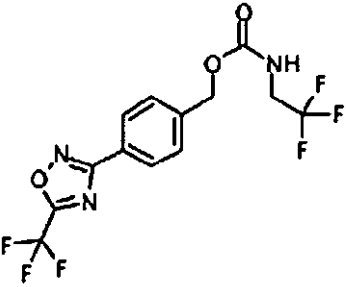
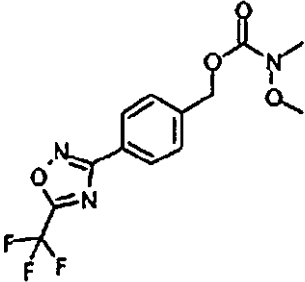
20

30

【 0 2 5 3 】

表T3: 式(1)の化合物に係る融点(mp)データおよび/または保持時間(Rt):

【表 1 2 - 1】

項目	化合物名	構造	R_t (分)	質量電荷 ($M+H$) +	方法	mp ($^{\circ}C$)
3.1	[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 <i>N,N</i> -ジメチルカルバメート		1.509	315.8	C	95 - 97
3.2	[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 <i>N</i> -シクロプロピルカルバメート		1.567	353.9	C	98 - 100
3.3	[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 <i>N</i> -(2,2,2-トリフルオロエチル)カルバメート		1.479	($M+H$) 観測されず	C	84 - 86
3.4	[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 <i>N</i> -メトキシ- <i>N</i> -メチルカルバメート		1.567	353.9	C	

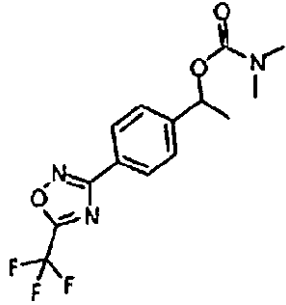
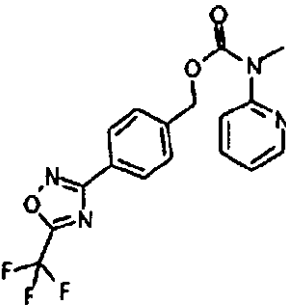
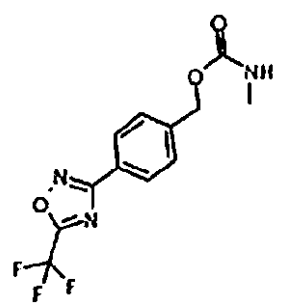
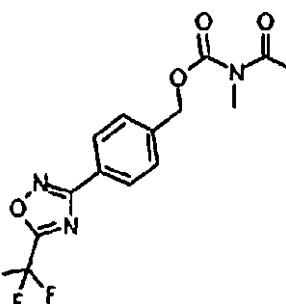
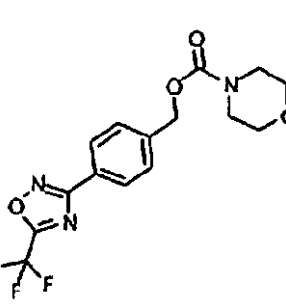
10

20

30

40

【表 1 2 - 2】

3.5	1-[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]エチル <i>N,N</i> -ジメチルカルバメート		1.62	(M+H) 観測されず	C	
3.6	[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 <i>N</i> -メチル- <i>N</i> -(2-ピリジル)カルバメート				C	110 - 112
3.7	[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 <i>N</i> -メチルカルバメート		1.493	301	C	100 - 102
3.8	[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 <i>N</i> -アセチル- <i>N</i> -メチルカルバメート		1.567	344	C	
3.9	[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]メチルモルホリン-4-カルボキシレート		1.533	M+H) 観測されず	C	71 - 74

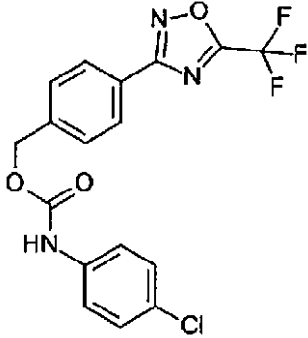
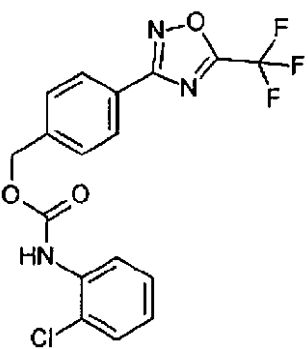
10

20

30

40

【表 1 2 - 3】

3.10	[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 N-(4-クロロフェニル)カルバメート		1.629	395.6	C	
3.11	[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 N-(2-クロロフェニル)カルバメート		1.707	395.5	C	

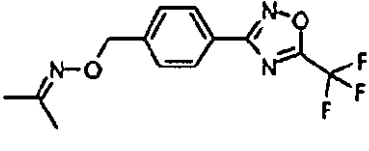
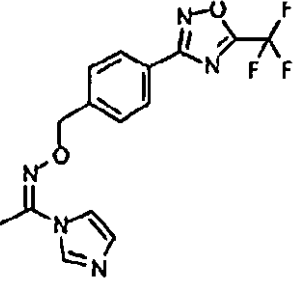
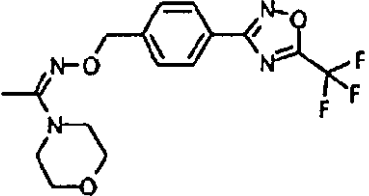
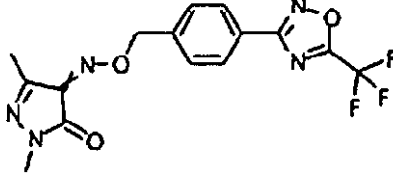
10

20

【 0 2 5 4】

表T4: 式(1)の化合物に係る融点(mp)データおよび/または保持時間(Rt):

【表 13】

項目	化合物名	構造	R _t (分)	質量 電荷 (M+H) +	方法	mp (°C)
4.1	<i>N</i> -[[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]メトキシ]プロパン-2-イミン					48 - 52
4.2	(<i>Z</i>)-1-イミダゾール-1-イル- <i>N</i> -[[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]メトキシ]エタンイミン					51 - 53
4.3	(<i>Z</i>)-1-モルホリノ- <i>N</i> -[[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]メトキシ]エタンイミン		観測されず			
4.4	2,5-ジメチル-4-[[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]メトキシイミノ]ピラゾール-3-オン					110 - 111

10

20

30

【0255】

生物学的実施例：

ウェルプレートにおける葉片テストの一般的実施例：

様々な植物種の葉片または葉切片を、温室で生育した植物から切り取る。切り取られた葉片または葉切片を、マルチウェルプレート（24ウェル型）中の素寒天培地上に載せる。播種前（予防）または播種後（治療）に、葉片にテスト溶液を噴霧する。テストされる化合物を、DMSO溶液（最大10mg/ml）として調製し、それを、噴霧の直前に0.025%のTween 20で適切な濃度に希釈する。播種された葉片または葉切片を、それぞれのテストシステムに応じて、所定の条件（温度、相対湿度、光など）下でインキュベートする。病害のレベルの単一の評価を、病原体応答系に応じて、播種から3～14日後に行う。次いで、未処理の検査用葉片または葉切片と比した病害防除割合を計算する。

40

【0256】

ウェルプレートにおける液体培養テストの一般的実施例：

真菌の液体培養から新たに調製されたかまたは極低温保管しておいた真菌の菌糸体断片

50

または分生子懸濁液を、栄養液体培地に直接混合する。テスト化合物（最大10mg/ml）のDMSO溶液を0.025%のTween 20で50倍に希釈し、10μlのこの溶液をピペットでマイクロタイタープレート（96ウェル型）に入れる。次いで、真菌の芽胞/菌糸断片を含有する栄養液体培地を加えて、テスト化合物の最終濃度を得る。テストプレートを、暗所にて24および96%の相対湿度でインキュベートする。真菌の成長の阻害を、病原体応答系に応じて、2~7日後に測光法により計測し、未処理の対照と比した抗真菌活性割合を計算する。

【0257】

実施例1：プッシニアレコンディタ *f. sp. tritici* (Puccinia recondita *f. sp. tritici*) に対する殺菌活性/コムギ/葉片予防（赤さび病）

10

コムギ葉切片 (cv. Kanzler) を、マルチウェルプレート（24ウェル型）中の寒天上に載せ、水で希釈された配合されたテスト化合物を噴霧した。葉片に、適用から1日後に真菌の孢子懸濁液を播種した。播種された葉切片を、気候キャビネット中において、12時間の光/12時間の暗闇の光環境下で、19および75%の相対湿度 (rh) でインキュベートし、化合物の活性を、適切なレベルの病害による損傷が、未処理の検査用葉切片に現われた時点で（適用から7~9日後）、未処理のものとは比した病害防除割合として評価した。

【0258】

以下の化合物は、適用される配合物中200ppmで、このテストにおいて、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照葉片と比して、少なくとも80%の病害防除をもたらす。

20

【0259】

化合物（表T1より）1.1、1.2、1.4、1.5、1.8、1.9、1.11、1.13、1.14、1.17、1.18、1.19、1.22、1.23および1.26。

化合物（表T2より）2.1。

化合物（表T3より）3.1、3.2、3.3および3.5。

化合物（表T4より）4.2および4.3。

【0260】

実施例2：プッシニアレコンディタ *f. sp. tritici* (Puccinia recondita *f. sp. tritici*) に対する殺菌活性/コムギ/葉片治療（赤さび病）

30

コムギ葉切片 (cv. Kanzler) を、マルチウェルプレート（24ウェル型）中の寒天上に載せる。次いで、葉切片に、真菌の孢子懸濁液を播種する。次いで、プレートを暗所にて19および75%の相対湿度で保管した。水で希釈された配合されたテスト化合物を、播種から1日後に適用した。葉切片を、気候キャビネット中において、12時間の光/12時間の暗闇の光環境下で、19および75%の相対湿度でインキュベートし、化合物の活性を、適切なレベルの病害による損傷が、未処理の検査用葉切片に現われた時点で（適用から6~8日後）、未処理のものとは比した病害防除割合として評価した。

40

【0261】

以下の化合物は、適用される配合物中200ppmで、このテストにおいて、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照葉片と比して、少なくとも80%の病害防除をもたらす。

【0262】

化合物（表T1より）1.1、1.2、1.4、1.5、1.6、1.7、1.8、1.9、1.10、1.11、1.13、1.15、1.17、1.18、1.19、1.22、1.23および1.26。

化合物（表T3より）3.1、3.2、3.3および3.5。

化合物（表T4より）4.1および4.2。

50

【0263】

実施例3：ファコプソラパチリジ (*Phakopsora pachyrhizi*) に対する殺菌活性 / ダイズ / 葉片予防 (アジア型ダイズさび病)

ダイズ葉片を、マルチウェルプレート (24ウェル型) 中の素寒天培地上に載せ、水で希釈された配合されたテスト化合物を噴霧する。適用から1日後、下側の葉面に孢子懸濁液を噴霧することによって、葉片に播種する。気候キャビネット中において、20 および75%のrhで、暗闇で24~36時間のインキュベーション期間の後、葉片を、12時間の光 / 日および75%のrhで、20 に保持する。化合物の活性を、適切なレベルの病害による損傷が、未処理の検査用葉片に現われた時点で (適用から12~14日後)、未処理のものとはした病害防除割合として評価する。

10

【0264】

以下の化合物は、適用される配合物中200ppmで、このテストにおいて、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照葉片と比して、少なくとも80%の病害防除をもたらす。

【0265】

化合物 (表T1より) 1.1、1.2、1.3、1.4、1.5、1.8、1.11、1.13、1.16、1.17、1.18、1.19、1.22 および 1.23。

化合物 (表T3より) 3.1 および 3.2。

化合物 (表T4より) 4.2 および 4.3。

20

【0266】

実施例4：グロメレララゲナリウム (*Glomerella lagenarium*) (コレトリカムラゲナリウム (*Colletotrichum lagenarium*)) に対する殺菌活性、液体培養 / キュウリ / 予防 (炭疽病)

極低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地 (PDB - ジャガイモブドウ糖液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96ウェル型) に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを24 でインキュベートし、適用から3~4日後に、成長の阻害を測光法により計測する。

【0267】

以下の化合物は、適用される配合物中20ppmで、このテストにおいて、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比して、少なくとも80%の病害防除をもたらす。

30

【0268】

化合物 (表T1より) 1.1、1.2、1.3、1.4、1.5、1.8、1.9、1.11、1.13、1.14、1.17、1.18、1.19、1.20、1.21、1.22、1.23、1.24、1.25 および 1.26。

化合物 (表T2より) 2.1、2.2 および 2.3。

化合物 (表T3より) 3.1、3.2、3.3、3.4 および 3.5。

化合物 (表T4より) 4.2、4.3 および 4.4。

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2017/058839

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D413/12 C07D271/06 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		
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		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2015/185485 A1 (BASF SE [DE]) 10 December 2015 (2015-12-10) cited in the application page 1, line 3 - line 9 page 1; compound I page 52 - page 55; table I page 56; table A page 56 - page 64; table W page 64 - page 67 claims -----	1-15
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> 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		Date of mailing of the international search report
12 May 2017		24/05/2017
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 Hoepfner, Wolfgang

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2017/058839

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2015185485 A1	10-12-2015	AU 2015270651 A1	22-12-2016
		CA 2950084 A1	10-12-2015
		CN 106455572 A	22-02-2017
		EP 3151669 A1	12-04-2017
		WO 2015185485 A1	10-12-2015

フロントページの続き

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード(参考)
A 0 1 N 47/18 (2006.01)	A 0 1 N 47/18	
A 0 1 N 47/24 (2006.01)	A 0 1 N 47/24	G
A 0 1 N 47/16 (2006.01)	A 0 1 N 47/18	1 0 1 A
A 0 1 N 47/20 (2006.01)	A 0 1 N 47/16	Z
A 0 1 P 3/00 (2006.01)	A 0 1 N 47/20	B
A 0 1 C 1/06 (2006.01)	A 0 1 P 3/00	
	A 0 1 C 1/06	Z

(81) 指定国 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, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, 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, NE, 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, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, 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, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ

(特許庁注：以下のものは登録商標)

1 . T W E E N

(74) 代理人 100119013

弁理士 山崎 一夫

(74) 代理人 100123777

弁理士 市川 さつき

(74) 代理人 100111796

弁理士 服部 博信

(74) 代理人 100162422

弁理士 志村 将

(72) 発明者 スティエルリ ダニエル

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72) 発明者 ホフマン トマス ジェイムズ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72) 発明者 プリオ マルタン

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション アクチェンゲゼルシャフト内

(72) 発明者 ラジャン ラムヤ

インド 4 0 3 1 1 0 ゴア イルハス コーリム シンジェンタ バイオサイエンスーズ プラ
イベート リミテッド サンタ モニカ ワークス内

Fターム(参考) 2B051 AA01 AB01 BA09 BB01 BB14

4C056 AA01 AB02 AC05 AD01 AE03 FA08 FB01 FC01

4C063 AA01 BB07 BB08 CC58 DD12 DD22 DD25 DD28 DD47 DD51

EE03

4H011 AA01 BB10 BB11 BB13 DA02 DA04 DA06 DA15 DA16