

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第6153619号
(P6153619)

(45) 発行日 平成29年6月28日 (2017. 6. 28)

(24) 登録日 平成29年6月9日 (2017. 6. 9)

(51) Int. Cl.

F I

A O 1 N 43/56 (2006. 01)

A O 1 N 43/56

C

A O 1 N 57/20 (2006. 01)

A O 1 N 57/20

G

A O 1 N 43/80 (2006. 01)

A O 1 N 57/20

L

A O 1 N 41/06 (2006. 01)

A O 1 N 43/56

E

A O 1 P 3/00 (2006. 01)

A O 1 N 43/80

I O I

請求項の数 16 (全 69 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2015-537246 (P2015-537246)
 (86) (22) 出願日 平成25年10月17日 (2013. 10. 17)
 (65) 公表番号 特表2015-536313 (P2015-536313A)
 (43) 公表日 平成27年12月21日 (2015. 12. 21)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2013/071694
 (87) 国際公開番号 W02014/060502
 (87) 国際公開日 平成26年4月24日 (2014. 4. 24)
 審査請求日 平成28年5月10日 (2016. 5. 10)
 (31) 優先権主張番号 12356025. 2
 (32) 優先日 平成24年10月19日 (2012. 10. 19)
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)
 (31) 優先権主張番号 61/730, 251
 (32) 優先日 平成24年11月27日 (2012. 11. 27)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

(73) 特許権者 507203353
 バイエル・クロップサイエンス・アクチエ
 ンゲゼルシャフト
 ドイツ国、4 0 7 8 9 ・モンハイム・アム
 ・ライン、アルフレート・ノベール・シュト
 ラーセ・5 0
 (74) 代理人 100114188
 弁理士 小野 誠
 (74) 代理人 100119253
 弁理士 金山 賢教
 (74) 代理人 100124855
 弁理士 坪倉 道明
 (74) 代理人 100129713
 弁理士 重森 一輝

最終頁に続く

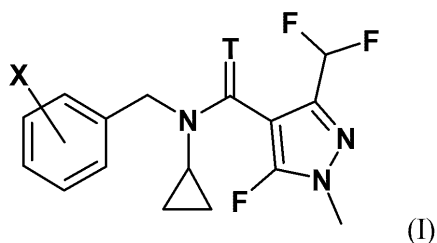
(54) 【発明の名称】 カルボキサミド誘導体を含む活性化合物の組み合わせ

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

(A) 式 (I)

【化 1】



の少なくとも 1 の誘導体であって、式中、T は酸素原子を表し、X は 2 - イソプロピル、2 - シクロプロピル、2 - tert - ブチル、5 - クロロ - 2 - エチル、5 - クロロ - 2 - イソプロピル、2 - エチル - 5 - フルオロ、5 - フルオロ - 2 - イソプロピル、2 - シクロプロピル - 5 - フルオロ、2 - フルオロ - 6 - イソプロピル、2 - エチル - 5 - メチル、2 - イソプロピル - 5 - メチル、2 - シクロプロピル - 5 - メチル、2 - tert - ブチル - 5 - メチル、5 - クロロ - 2 - (トリフルオロメチル)、5 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル)、2 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル)、3 - クロロ - 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) および 2 - エチル - 4 , 5 - ジメチルのリストから選

扱われる誘導体、または農薬的に許容されるその塩、
ならびに

(B) グリホサート、グリホサート - ナトリウム、グリホサート - イソプロピルアンモニウム、ピラナホス、グルホシネートおよびグルホシネート - アンモニウムから選択される少なくとも 1 のさらなる除草活性化合物

および / または

(D) 農薬の植物毒性作用を低減させるためのメフェンピル - ジエチル、イソキサジフェン - エチルおよびシプロスルファミドから選択される少なくとも 1 の毒性緩和剤を含む、活性化合物の組み合わせ組成物。

【請求項 2】

10

成分 (A)、(B) および (D) を含む請求項 1 に記載の活性化合物の組み合わせ組成物。

【請求項 3】

式 (I) の化合物が、

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 1)、
N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 2)、
N - (2 - tert - ブチルベンジル) - 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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 3)

20

、
N - (5 - クロロ - 2 - エチルベンジル) - 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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 4)、

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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 5)、

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - フルオロベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 6)、

30

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (5 - フルオロ - 2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 7)、

N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - フルオロベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 8)、

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - フルオロ - 6 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 10)、

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - メチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 11)、

40

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピル - 5 - メチルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 12)、

N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - メチルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 13)、

N - (2 - tert - ブチル - 5 - メチルベンジル) - 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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (

50

化合物 A 1 4)、

N - [5 - クロロ - 2 - (トリフルオロメチル)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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 1 5)、

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 - N - [5 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル)ベンジル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 1 6)、

N - [2 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル)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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 1 7)、

N - [3 - クロロ - 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル)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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 1 8) および

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 4 , 5 - ジメチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 1 9) よりなる群から選択される、請求項 1 または 2 に記載の活性化合物の組み合わせ組成物。

【請求項 4】

式 (I) の化合物が 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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドである、請求項 3 に記載の活性化合物の組み合わせ組成物。

【請求項 5】

請求項 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の活性化合物の組み合わせ組成物を含み、および助剤、溶媒、担体、界面活性剤または増量剤をさらに含む組成物。

【請求項 6】

請求項 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の活性化合物の組み合わせ組成物または請求項 5 に記載の組成物が種子、植物、植物の果実または植物が生育するもしくは生育することになる土壌に施用されることを特徴とする、作物保護において植物病原性真菌を防除する方法。

【請求項 7】

植物、植物の果実または植物が生育するもしくは生育が意図される土壌が処理されることを特徴とする、請求項 6 に記載の方法。

【請求項 8】

葉の処理において 0 . 1 から 1 0 , 0 0 0 g / h a まだが、および種子の処理において種子 1 0 0 k g あたり 2 から 2 0 0 g まだが使用されることを特徴とする、請求項 6 に記載の方法。

【請求項 9】

作物保護において望まれない植物病原性真菌を防除するための、請求項 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の活性化合物の組み合わせ組成物または請求項 5 に記載の組成物の使用。

【請求項 1 0】

種子、遺伝子導入植物の種子および遺伝子導入植物を処理するための、請求項 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の活性化合物の組み合わせ組成物または請求項 5 に記載の組成物の使用。

【請求項 1 1】

請求項 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の活性化合物の組み合わせ組成物または請求項 5 に記載の組成物で処理された種子。

【請求項 1 2】

有用な植物または作物植物を駆除剤の植物毒性副作用から保護する方法であって、有効量の請求項 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の活性化合物の組み合わせ組成物または請求項 5 に記載の組成物を植物、植物の部分、植物種子または種子に施用することを含む、前記

10

20

30

40

50

方法。

【請求項 1 3】

施用が出芽後法によるものである、請求項 1 2 に記載の方法。

【請求項 1 4】

組成物の施用が植物種子または種子を処理することによるものである、請求項 1 2 に記載の方法。

【請求項 1 5】

施用が出芽前法によるものである、請求項 1 2 に記載の方法。

【請求項 1 6】

有用植物の作物における有害植物の選択的防除方法であって、有効な有用植物保護量の請求項 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の活性化合物の組み合わせ組成物または請求項 5 に記載の組成物を植物、植物の部分、植物種子または種子に施用することを含む、前記方法。

10

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、活性化合物の組み合わせに関し、詳細には、組成物内に、(A) N - シクロプロピル - N - [置換 - ベンジル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドまたはチオカルボキサミド誘導体、ならびに (B) さらなる除草活性化合物または (C) 植物成長調節物質および / または (D) 農薬の植物毒性作用を低減させるための毒性緩和剤を含む組み合わせに関する。そのうえ、本発明は、植物または作物の植物病原性真菌を治療的または予防的に防除する方法、種子の処理のための本発明による組み合わせの使用、種子を保護する方法に関し、処理された種子だけに関するものではない。

20

【背景技術】

【0002】

N - シクロプロピル - N - [置換 - ベンジル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドまたはチオカルボキサミド誘導体、市販材料からのそれらの調製および殺真菌剤としてのそれらの使用は、WO 2007 / 087906、WO 2009 / 016220、WO 2010 / 130767 および EP 2251331 中に開示されている。これらの化合物を殺真菌剤として用いることができること、および他の殺真菌剤または殺虫剤と混合することができることもまた公知である (特許出願 PCT / EP 2012 / 001676 および PCT / EP 2012 / 001674 を参照されたい)。

30

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献 1】WO 2007 / 087906

【特許文献 2】WO 2009 / 016220

【特許文献 3】WO 2010 / 130767

40

【特許文献 4】EP 2251331

【特許文献 5】PCT / EP 2012 / 001676

【特許文献 6】PCT / EP 2012 / 001674

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

現代の作物保護組成物に課せられた環境的および経済的要件は、例えば作用スペクトル、毒性、選択性、施用量、残留物の形成および好都合な製剤能力 (preparation ability) に関して継続的に増大していることから、ならびにさらには、例えば抵抗性の問題もあり得ることから、いくつかの領域において上述の要件を満たすこと

50

にせめて役立つ新たな組成物、とりわけ殺真菌性の剤を開発することは定常的な課題である。本発明は、いくつかの態様において述べられた目的をせめて達成する活性化合物の組み合わせ/組成物を提供する。

【0005】

農業または林業に有用な植物の作物において駆除剤を用いることにより望まれない生物を防除する際、有用植物も時に、使用される駆除剤によって多かれ少なかれ損傷される。この望まれない植物毒性作用は、とりわけ、有用植物の作物、例えば、コーン、イネまたは穀物などにおける相当数の除草剤の使用に伴って、主に出芽後施用において遭遇するものである。いくつかの事例において、毒性緩和剤または解毒剤を使用することにより、有害生物に対する駆除活性を減らすまたは実質的に損なうことなく、駆除剤の植物毒性から有用植物を保護することができる。いくつかの場合において、有害生物、例えば雑草などに対する駆除作用の改良さえも観察された。

10

【課題を解決するための手段】

【0006】

ここに驚くべきことに、本発明による組み合わせは、原理的に予想された防除対象の植物病原体に関する作用スペクトルの相加的増強をもたらすだけでなく、構成成分(A)の作用範囲および構成成分(B)の作用範囲を二通りに拡張する相乗効果を達成することが見出された。第一に、構成成分(A)および構成成分(B)の施用量は、作用は同等に良好なままでありながらも、少なくなる。第二に、組み合わせは、2つの個々の化合物がかかる低施用量の範囲において全体的に有効でなくなった場合でさえ、高度の植物病原体防除をなお達成する。このことは、一方で防除することができる植物病原体のスペクトルを実質的に広幅化させ、他方で使用時の安全性を向上させる。

20

【0007】

殺真菌性の相乗的活性に加えて、本発明による活性化合物の組み合わせは、広義で相乗的とも呼ばれ得るさらなる驚くべき性質を持ち、これらは例えば：他の植物病原体に対する、例えば植物病の抵抗性株に対する活性スペクトルの広幅化；活性化合物のより少ない施用量；個々の化合物が活性を示さないまたは実質的に活性を示さない施用量であってさえも十分な、本発明による活性化合物の組み合わせを用いた有害生物の防除；製剤中または使用中の、例えば粉砕、篩分け、乳化、溶解または分散中の有利な挙動；保存安定性および光安定性の改良；有利な残留物形成；毒物学的または生態毒物学的な挙動の改良；植物の性質の改良、例えばより良好な成長、収穫量の増加、根系のより良好な発達、より大きな葉面積、より濃い緑色の葉、より強い新芽、必要とされる種子がより少ないこと、より低い植物毒性、植物の防御系の動員、植物との良好な適合性などである。それゆえに、本発明による活性化合物の組み合わせまたは組成物の使用は、幼穀物が健全であることを維持することに相当に寄与し、このことは、例えば、処理された穀物種子の冬期生存性を向上させ、ならびにまた品質および収量を守る。そのうえ、本発明による活性化合物の組み合わせは、浸透移行作用の増強に寄与し得る。組み合わせの個々の化合物が十分な浸透移行性を持たなくとも、本発明による活性化合物の組み合わせはこの性質をなお持ち得る。同様に、本発明による活性化合物の組み合わせは、殺真菌作用のより高い持続性をもたらし得る。

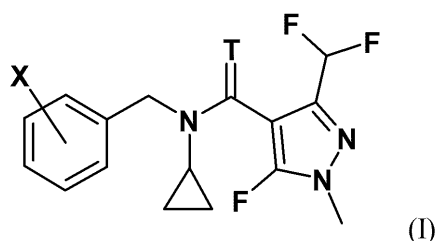
30

40

【0008】

したがって、本発明は、
(A)式(I)

【化 1】



【 0 0 0 9 】

の少なくとも 1 の誘導体であって、式中、T は酸素原子もしくは硫黄原子を表し、X は 2 - イソプロピル、2 - シクロプロピル、2 - tert - ブチル、5 - クロロ - 2 - エチル、5 - クロロ - 2 - イソプロピル、2 - エチル - 5 - フルオロ、5 - フルオロ - 2 - イソプロピル、2 - シクロプロピル - 5 - フルオロ、2 - シクロペンチル - 5 - フルオロ、2 - フルオロ - 6 - イソプロピル、2 - エチル - 5 - メチル、2 - イソプロピル - 5 - メチル、2 - シクロプロピル - 5 - メチル、2 - tert - ブチル - 5 - メチル、5 - クロロ - 2 - (トリフルオロメチル)、5 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル)、2 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル)、3 - クロロ - 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) および 2 - エチル - 4, 5 - ジメチルのリストから選択される誘導体、または農薬的に許容されるその塩、

ならびに

(B) 少なくとも 1 のさらなる除草活性化合物

または

(C) 少なくとも 1 の植物成長調節物質

および / または

(D) 農薬の植物毒性作用を低減させるための少なくとも 1 の毒性緩和剤を含む組み合わせを提供する。

【 0 0 1 0 】

好ましいのは、

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 1)、

N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 2)、

N - (2 - tert - ブチルベンジル) - 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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 3) 、

N - (5 - クロロ - 2 - エチルベンジル) - 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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 4) 、

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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 5) 、

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - フルオロベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 6) 、

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (5 - フルオロ - 2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 7) 、

N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - フルオロベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 8) 、

N - (2 - シクロペンチル - 5 - フルオロベンジル) - 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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 9) 、

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - フルオロ - 6 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 10) 、

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - メチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 11) 、

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピル - 5 - メチルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 12) 、

N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - メチルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 13) 、

N - (2 - t e r t - ブチル - 5 - メチルベンジル) - 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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 14) 、

N - [5 - クロロ - 2 - (トリフルオロメチル) 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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 15) 、

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 - N - [5 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 16) 、

N - [2 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル) 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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 17) 、

N - [3 - クロロ - 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) 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 - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 18) 、

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 4 , 5 - ジメチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物 A 19) 、

および N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボチオ - アミド (化合物 A 20)

よりなる群から選択される、式 (I) の少なくとも 1 の化合物を含む組み合わせである。

【発明を実施するための形態】

【 0 0 1 1 】

混合物の製剤中またはタンクミックス (t a n k - m i x) 中で、式 (I) の活性のある N - シクロプロピル - N - [置換 - ベンジル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドまたはチオカルボキサミド誘導体の組み合わせ相手として適しているのは、例えば、その作用が、例えば、アセトラクテートシンターゼ、アセチル - コエンザイム - A カルボキシラーゼ、P S I、P S I I、H P P D O、フィトエンデサチュラーゼ、プロトポルフィリノーゲンオキシダーゼ、グルタミンシンターゼ、セルロース生合成、5 - エノールピルビルシキメート 3 - ホスフェートシンターゼの阻害に基づく、公知の、好ましくは除草活性化合物である。かかる化合物およびまた用いることができる他の化合物は、いくつかの場合に未知のまたは異なる作用メカニズムを持ち、例えば、Weed Research 26, 441 - 445 (1986) 中に、または全てが B r i t i s h C r o p P r o t e c t i o n C o

10

20

30

40

50

uncilにより発行されたものである“ The Pesticide Manual ”, 12th edition 2000、もしくは13th edition 2003、もしくは14th edition 2006/2007、もしくは対応する“ e - Pesticide Manual ”, version 4 (2006) (以下、短縮して「PM」ともいう)中に、およびそれらの中で引用されている文献中に記載されている。「一般名」のリストはまた、インターネット上の“ The Compendium of Pesticide Common Names ”中でも入手可能である。

【0012】

式(I)のN - シクロプロピル - N - [置換 - ベンジル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドまたはチオカルボキサミド誘導体と組み合わせられ得る、文献から公知の除草剤およびまた毒性緩和剤の例は、本明細書中で指示されている活性化合物である(注:化合物は、国際標準化機構(ISO)に従って「一般名」により、または化学名により、適切な場合は慣例的なコード番号と共に言及される):

アセトクロル; アシベンゾラル - S - メチル; アシフルオルフェン(-ナトリウム); アクロニフェン; AD - 67; AKH 7088、すなわち[[[1 - [5 - [2 - クロロ - 4 - (トリフルオロメチル)フェノキシ] - 2 - ニトロフェニル] - 2 - メトキシエチリデン]アミノ]オキシ]酢酸およびメチル[[[1 - [5 - [2 - クロロ - 4 - (トリフルオロメチル)フェノキシ] - 2 - ニトロフェニル] - 2 - メトキシエチリデン]アミノ]オキシ]アセテート; アラクロル; アロキシジム(-ナトリウム); アメトリン; アミカルバゾン、アミドクロル、アミドスルフロン; アミノピラリド; アミトロール; AMS、すなわちアンモニウムスルファメート; アンシミドール; アニロホス; アシュラム; アトラジン; アビグリシン; アザフェニジン、アジムスルフロン(DPX - A8947); アジプロトリン; パーバン; BAS 516 H、すなわち5 - フルオロ - 2 - フェニル - 4H - 3, 1 - ベンゾキサジン - 4 - オン; ベフルブタミド(UBH - 509)、ベナゾリン(-エチル); ベンカルバゾン; ベンフルラリン; ベンフレセート; ベノキサコール; ベンスルフロン(-メチル); ベンスリド; ベンタゾン; ベンズフェンジゾン; ベンゾピシクロン、ベンゾフェナップ; ベンゾフルオル; ベンゾイルプロップ(-エチル); ベンズチアズロン; ピアラホス; ピフェノックス; ビスピリバック(-ナトリウム)(KIH - 2023); ホウ砂; プロマシル; プロモブチド; プロモフェノキシム; プロモキシニル; プロムロン; プミナホス; ブソキシノン; ブタクロル; ブタフェナシル、ブタミホス; ブテナクロル(KH - 218); ブチダゾール; ブトラリン; ブトロキシジム、ブチレート; カフェンストロール(CH - 900); カルベタミド; カルフェントラゾン(-エチル); CDA A、すなわち2 - クロロ - N, N - ジ - 2 - プロペニルアセトアミド; CDEC、すなわち2 - クロルアリルジエチルジチオカルバメート; クロメトキシフェン; クロランベン; クロラジホップ - ブチル、クロルプロムロン; クロルブファム; クロルフェナック; クロルフェンプロップ; クロルフレルコール(-メチル); クロルフレルノール(-メチル); クロリダゾン; クロリムロン(-エチル); クロルメコート(-クロリド); クロルニトロフェン; クロロフタリム(MK - 616); クロロトルロン; クロロクスロン; クロルプロファム; クロルスルフロン; クロルタール - ジメチル; クロルチアミド; クロルトルロン、シニドン(-メチルおよび - エチル)、シンメチリン; シノスルフロン; クレホキシジム、クレトジム; クロジナホップおよびそのエステル誘導体(例えばクロジナホップ - プロパルギル); クロフェンセット; クロマゾン; クロメプロップ; クロプロップ; クロプロキシジム; クロピラリド; クロピラスルフロン(-メチル)、クロキントセット(-メキシル); クロランスラム(-メチル)、クミルロン(JC 940); シアナミド; シアナジン; シクロエート; シクロスルファムロン(AC 104); シクロキシジム; シクルロン; シハロホップおよびそのエステル誘導体(例えばそのブチルエステル、DEH - 112); シベルコート; シブラジン; シブラゾール; シプロスルファミド; ダイムロン; 2, 4 - D、2, 4 - DB; ダラボン; ダミノジド; ダゾメット; n - デカノール; デスメジファム; デスメトリン; ジアレート; ジカンバ; ジ

10

20

30

40

50

クロベニル；ジクロルミド；ジクロルプロップ（-P）塩；ジクロホップおよびそのエステル、例えばジクロホップ-メチルなど；ジクロホップ-P（-メチル）；ジクロスラム、ジエタチル（-エチル）；ジフェノクスロン；ジフェンゾコート（メチルサルフェート）；ジフルフェニカン；ジフルフェンゾピル（-ナトリウム）；ジメフロソ；ジメピペレート、ジメタクロル；ジメタメトリン；ジメタゾン；ジメテナミド（S A N - 5 8 2 H）；ジメテナミド-P；ジメチルアルシン酸；ジメチピン；ジメトラスルフロソ、ジニトラミン；ジノセブ；ジノテルブ；ジフェナミド；ジプロペトリン；ジクワット塩；ジチオピル；ジウロン；D N O C；エグリナジン-エチル；E L 7 7、すなわち5-シアノ-1-（1, 1-ジメチルエチル）-N-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド；エンドタール；エポプロダン、E P T C；エスプロカルブ；エタルフルラリン；エタメトスルフロソ-メチル；エテホン；エチジムロン；エチオジン；エトフメセート；エトキシフェンおよびそのエステル（例えばそのエチルエステル、H N - 2 5 2）；エトキシスルフロソ、エトベンザニド（H W 5 2）；F 5 2 3 1、すなわちN-[2-クロロ-4-フルオロ-5-[4-(3-フルオロプロピル)-4, 5-ジヒドロ-5-オキソ-1H-テトラゾール-1-イル]フェニル]エタンスルホンアミド；フェンクロラゾール（-エチル）；フェンクロリム；フェノプロップ；フェノキサソ、フェノキサプロップおよびフェノキサプロップ-Pならびにまたそれらのエステル、例えばフェノキサプロップ-P-エチルおよびフェノキサプロップ-エチル；フェノキシジム（f e n o x y d i m）；フェントラザミド、フェヌロン；硫酸第一鉄；フラムプロップ（-メチルまたは-イソプロピルまたは-イソプロピル-L）；フラムプロップ-M（-メチルまたは-イソプロピル）；フラザスルフロソ；フロラスラム、フルアジホップおよびフルアジホップ-Pならびにそれらのエステル、例えばフルアジホップ-ブチルおよびフルアジホップ-P-ブチル；フルアゾレート、フルカルバゾン（-ナトリウム）、フルセトスルフロソ；フルクロラリン；フルフェナセット；フルフェンピル（-エチル）；フルメトラリン；フルメツラム；フルメツロン；フルミクロラック（-ベンチル）、フルミオキサジン（S - 4 8 2）；フルミプロピン；フルオメツロン、フルオロクロリドン、フルオロジフェン；フルオログリコフェン（-エチル）；フルボキサム（K N W - 7 3 9）；フルプロパシル（U B I C - 4 2 4 3）；フルプロパノエート；フルピルスルフロソ（-メチル）（-ナトリウム）；フルラゾール；フルレノール（-ブチル）；フルリドン；フルロクロリドン；フルロキシピル（-メプチル）；フルルプリミドール、フルルタモン；フルチアセット（-メチル）（K I H - 9 2 0 1）；フルチアミド、フルキソフェニム；ホメサフェン；ホラムスルフロソ、ホルクロルフェヌロン；ホサミン；フリラゾール；フリロキシフェン；ジベレリン酸（g i b b e r i l l i c a c i d）；グルホシネート（-アンモニウム）；グリホサート（-イソプロピルアンモニウム）；ハロサフェン；ハロスルフロソ（-メチル）；ハロキシホップおよびそのエステル；ハロキシホップ-P（= R - ハロキシホップ）およびそのエステル；H C - 2 5 2；ヘキサジノン；イマザメタベンズ（-メチル）；イマザメタピル、イマザモックス、イマザピック、イマザピル；イマザキンおよび塩、例えばそのアンモニウム塩など；イマゼタメタピル（i m a z e t h a m e t h a p y r）；イマゼタピル；イマゾスルフロソ；イナベンフィド；インダノファン；インドール-3-酢酸；4-インドール-3-イル酪酸；ヨードスルフロソ-メチル（-ナトリウム）；イオキシニル；イソカルバミド；イソプロパリン；イソプロツロン；イソウロン；イソキサベン；イソキサクロルトール、イソキサジフェン（-エチル）；イソキサフルトール、イソキサピリホップ；カルブチレート；ラクトフェン；レナシル；リヌロン；マレイン酸ヒドラジド（M H）、M C P A；M C P B；メコプロップ（-P）；メフェナセット；メフェンピル（-ジエチル）；メフルイジド；メピコート（-クロリド）；メソスルフロソ（-メチル）；メソトリオン、メタム；メタミホップ；メタミトロン；メタザクロル；メタベンズチアズロン；メタム；メタゾール；メトキシフェノン；メチルアルソン酸；メチルシクロプロペン；メチルダイムロン；メチルイソチオシアネート；メタベンズチアズロン；メトベンズロン；メトプロムロン；（アルファ-）メトラクロル；メトスラム（X R D 5 1 1）；メトクスロン；メトリブジン；メトスルフロソ-メチル；モリネート；モナ

10

20

30

40

50

リド；モノカルバミドジヒドロゲンサルフェート；モノリヌロン；モヌロン；MT 128、すなわち6-クロロ-N-(3-クロロ-2-プロペニル)-5-メチル-N-フェニル-3-ピリダジンアミン；MT 5950、すなわちN-[3-クロロ-4-(1-メチルエチル)フェニル]-2-メチルペンタンアミド；ナプロアニリド；ナプロパミド；ナブタラム；NC 310、すなわち4-(2,4-ジクロロベンゾイル)-1-メチル-5-ベンジルオキシピラゾール；ネブロン；ニコスルフロ；ニピラクロフェン；ニトラリン；ニトロフェン；ニトロフェノレート混合物；ニトロフルオルフェン；ノナン酸；ノルフルラゾン；オルベンカルブ；オルタスルファムロン(orthasulfamuron)；オキサベトリニル；オリザリン；オキサジアルギル(RP-020630)；オキサジアゾン；オキサスルフロ、オキサジクロメホン、オキシフルオルフェン；バクロブトラゾール；パラコート(ジクロリド)；ペプレート；ペラルゴン酸、ペンジメタリン；ベノクススラム；ペンタクロロフェノール；ペンタノクロル；ペントキサゾン、パーフルイドン；ペトキサミド；フェニソファム；フェンメジファム；ピクロラム；ピコリナフェン、ピノキサデン、ピペロホス；ピリブチカルブ；ピリフェノップ-ブチル；プレチラクロル；プリミスルフロ(-メチル)；プロベナゾール；プロカルバゾン-(ナトリウム)、プロシアジン；プロジアミン；プロフルラリン；プロホキシジム；プロヘキサジオン(-カルシウム)；プロヒドロジャスモン；プログリナジン(-エチル)；プロメトン；プロメトリン；プロバクロル；プロパニル；プロパキサホップ；プロパジン；プロファム；プロピソクロル；プロボキシカルバゾン(-ナトリウム)(MKH-6561)；n-プロビルジヒドロジャスモネート；プロビザミド；プロスルファリン；プロスルホカルブ；プロスルフロ(CGA-152005)；プリナクロル；ピラクロニル；ピラフルフェン(-エチル)(ET-751)；ピラスルホトール；ピラゾリネート；ピラゾン；ピラゾスルフロ(-エチル)；ピラゾキシフェン；ピリベンゾキシム、ピリブチカルブ、ピリダホル、ピリデート；ピリフタリド；ピリミノバック(-メチル)(KIH-6127)；ピリミスルファン(KIH-5996)；ピリチオバック(-ナトリウム)(KIH-2031)；ピロキサスルホン(KIH-485)；ピロキソホップ(pyroxofop)およびそのエステル(例えばそのプロパルギルエステル)；ピロクススラム；キンクロラック；キンメラック；キノクラミン、キノホップおよびそのエステル誘導体、キサロホップおよびキサロホップ-Pならびにそれらのエステル誘導体、例えばキサロホップ-エチル；キサロホップ-P-テフリルおよび-エチル；レンリデュロン(renriduron)；リムスルフロ(DPX-E 9636)；S 275、すなわち2-[4-クロロ-2-フルオロ-5-(2-プロピニルオキシ)フェニル]-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-インダゾール；サフルフェナシル、セクブメトン；セトキシジム；シデュロン；シマジン；シメトリン；シントフェン；SN 106279、すなわち2-[[7-[2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-2-ナフタレニル]オキシ]プロパン酸およびメチル 2-[[7-[2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-2-ナフタレニル]オキシ]プロパノエート；スルコトリオン、スルフェントラゾン(FMC-97285、F-6285)；スルファズロン；スルホメツロン(-メチル)；スルホサート(ICI-A0224)；スルホスルフロ、TCA；テブタム(GCP-5544)；テブチウロン；テクナセン(tecnacene)；テンボトリオン；テフリルトリオン；テブラロキシジム、テルバシル；テルブカルブ；テルブクロル；テルブメトン；テルブチラジン；テルブトリン；TFH 450、すなわち

N,N-ジエチル-3-[(2-エチル-6-メチルフェニル)スルホニル]-1H-1,2,4-トリアゾール-1-カルボキサミド；テニルクロル(NSK-850)；チアフルアミド、チアザフルロン；チアゾピル(Mon-13200)；チジアジミン(SN-24085)；チジアズロン；チエンカルバゾン-メチル；チフェンスルフロ(-メチル)；チオベンカルブ；Ti 35；チオカルバジル；トブラメゾン；トラルコキシジム；トリアレート；トリアスルフロ；トリアジフラム、トリアゾフェナミド；トリベヌロン(-メチル)；トリクロビル；トリジファン；トリエタジン；トリフロキシスルフロ

ン；トリフルラリン；トリフルスルフロンおよびエステル（例えばそのメチルエステル、DPX - 66037）；トリメツロン；トリネキサパック；トリトスルフロン、チトデフ（tsitodef）；ウニコナゾール；ベルノレート；WL 110547、すなわち5 - フェノキシ - 1 - [3 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 1H - テトラゾール；D - 489；LS 82 - 556；KPP - 300；NC - 324；NC - 330；DPX - N8189；SC - 0774；DOWCO - 535；DK - 8910；V - 53482；PP - 600およびMBH - 001。

【0013】

式(I)のN - シクロプロピル - N - [置換 - ベンジル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドまたはチオカルボキサミド誘導体との組み合わせに適しているグループ(B)の除草剤は、好ましくは、以下よりなる群から選択される：

(B - 1)以下よりなる群から選択されるフェノキシフェノキシ - およびヘテロアリールオキシフェノキシカルボン酸誘導体のタイプの除草剤

(B - 1.1)フェノキシフェノキシ - およびベンジルオキシフェノキシカルボン酸誘導体、例えば(B - 1.1.1)メチル 2 - (4 - (2, 4 - ジクロロフェノキシ)フェノキシ)プロピオネート(ジクロホップ - メチル)、(B - 1.1.2)メチル 2 - (4 - (4 - ブロモ - 2 - クロロフェノキシ)フェノキシ)プロピオネート(DE - A2601548)、(B - 1.1.3)メチル 2 - (4 - (4 - ブロモ - 2 - フルオロフェノキシ)フェノキシ)プロピオネート(US4, 808, 750)、(B - 1.1.4)メチル 2 - (4 - (2 - クロロ - 4 - トリフルオロメチルフェノキシ)フェノキシ)プロピオネート(DE - A2433067)、(B - 1.1.5)メチル 2 - (4 - (2 - フルオロ - 4 - トリフルオロメチルフェノキシ)フェノキシ)プロピオネート(US4, 808, 750)、(B - 1.1.6)メチル 2 - (4 - (2, 4 - ジクロロベンジル)フェノキシ)プロピオネート(DE - A2417487)、(B - 1.1.7)エチル 4 - (4 - (4 - トリフルオロメチルフェノキシ)フェノキシ)ペンタ - 2 - エノエート、(B - 1.1.8)メチル 2 - (4 - (4 - トリフルオロメチルフェノキシ)フェノキシ)プロピオネート(DE - A2433067)、(B - 1.1.9)ブチル(R) - 2 - [4 - (4 - シアノ - 2 - フルオロフェノキシ)フェノキシ]プロピオネート(シハロホップ - ブチル)；

(B - 1.2)「単環式の」ヘテロアリールオキシフェノキシアルカンカルボン酸誘導体、例えば(B - 1.2.1)エチル 2 - (4 - (3, 5 - ジクロロピリジル - 2 - オキシ)フェノキシ)プロピオネート(EP - A0002925)、(B - 1.2.2)プロパルギル 2 - (4 - (3, 5 - ジクロロピリジル - 2 - オキシ)フェノキシ)プロピオネート(EP - A0003114)、(B - 1.2.3)メチル(RS) - または(R) - 2 - (4 - (3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジルオキシ)フェノキシ)プロピオネート(ハロキシホップ - メチルまたはハロキシホップ - P - メチル)、(B - 1.2.4)エチル 2 - (4 - (3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジルオキシ)フェノキシ)プロピオネート(EP - A0003890)、(B - 1.2.5)プロパルギル 2 - (4 - (5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - ピリジルオキシ)フェノキシ)プロピオネート(クロジナホップ - プロパルギル)、(B - 1.2.6)ブチル(RS) - または(R) - 2 - (4 - (5 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジルオキシ)フェノキシ)プロピオネート(フルアジホップ - ブチルまたはフルアジホップ - P - ブチル)、(B - 1.2.7)(R) - 2 - [4 - (3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジルオキシ)フェノキシ]プロピオン酸；

(B - 1.3)「二環式の」ヘテロアリールオキシフェノキシアルカンカルボン酸誘導体、例えば(B - 1.3.1)キザロホップ - メチル、(B - 1.3.2)キザロホップ - エチル、(B - 1.3.3)キザロホップ - P - メチル、(B - 1.3.4)キザロホップ - P - エチル、(B - 1.3.5)メチル 2 - (4 - (6 - フルオロ - 2 - キノキサリルオキシ)フェノキシ)プロピオネート(J. Pest. Sci. 1985, 10, 6

10

20

30

40

50

1を参照されたい)、(B-1.3.6)プロパキザホップ、(B-1.3.7)エチルフェノキサプロップ-エチル、(B-1.3.8)フェノキサプロップ-P-エチル、(B-1.3.9)エチル 2-(4-(6-クロロベンズチアゾール-2-イルオキシ)フェノキシ)プロピオネート(DE-A-2640730)、(B-1.3.10)テトラヒドロ-2-フリルメチル(RS)-または(R)-2-(4-(6-クロロキノキサリルオキシ)フェノキシ)プロピオネート(EP-A0323727)、(B-1.3.11)(R)-2-[4-(6-クロロ-1,3-ベンゾキサゾール-2-イルオキシ)フェノキシ]-2'-フルオロ-N-メチルプロピオンアニリド(メタミホップ); (B-2)スルホニルウレア、例えばピリミジニル-またはトリアジニルアミノカルボニル[ベンゼン-、-ピリジン-、-ピラゾール-、-チオフェン-および-(アルキルスルホニル)アルキルアミノ]スルファミドなどであって、ピリミジン環またはトリアジン環上にアルコキシ、アルキル、ハロアルコキシ、ハロアルキル、ハロゲンまたはジメチルアミノから選択される好ましい置換基を有し、全ての置換基を互いに独立して組み合わせることが可能であり、ベンゼン、ピリジン、ピラゾール、チオフェンまたは(アルキルスルホニル)アルキルアミノ部分においてアルキル、アルコキシ、ハロゲン、ニトロ、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルコキシアミノカルボニル、ハロアルコキシ、ハロアルキル、アルキルカルボニル、アルコキシアルキル、(アルカンスルホニル)アルキルアミノから選択される好ましい置換基を有するスルホニルウレアの群からの除草剤であって、このスルホニルウレアは、以下よりなる群から選択される。

【0014】

(B-2.1)フェニル-およびベンジルスルホニルウレアならびに類縁の化合物、例えば(B-2.1.1)クロルスルフロン、(B-2.1.2)クロリムロン-エチル、(B-2.1.3)メトスルフロン-メチル、(B-2.1.4)トリアスルフロン、(B-2.1.5)スルホメツロン-メチル、(B-2.1.6)トリベヌロン-メチル、(B-2.1.7)ベンスルフロン-メチル、(B-2.1.8)プリミスルフロン-メチル、(B-2.1.9)3-(4-エチル-6-メトキシ-1,3,5-トリアジン-2-イル)-1-(2,3-ジヒドロ-1,1-ジオキソ-2-メチルベンゾ[b]チオフェン-7-スルホニル)ウレア(EP-A007983)、(B-2.1.10)3-(4-エトキシ-6-エチル-1,3,5-トリアジン-2-イル)-1-(2,3-ジヒドロ-1,1-ジオキソ-2-メチルベンゾ[b]-チオフェン-7-スルホニル)ウレア(EP-A0079683)、(B-2.1.11)3-(4-メトキシ-6-メチル-1,3,5-トリアジン-2-イル)-1-(2-メトキシカルボニル-5-ヨードフェニルスルホニル)ウレア(WO92/13845)、(B-2.1.12)トリフルスルフロン-メチル、(B-2.1.13)オキサスルフロン、(B-2.1.14)ヨードスルフロン-メチル、(B-2.1.15)ヨードスルフロン-メチル-ナトリウム、(B-2.1.16)メソスルフロン、(B-2.1.17)メソスルフロン-メチル、(B-2.1.18)ホラムスルフロン、(B-2.1.19)シノスルフロン、(B-2.1.20)エタメトスルフロン-メチル、(B-2.1.21)プロスルフロン、(B-2.1.22)トリトスルフロン、(B-2.1.23)モノスルフロン、(B-2.1.24)メチル 2-[({ [メトキシ-6-(メチルチオ)ピリミジン-2-イル]カルバモイル}アミノ)スルホニル]ベンゾエート;

(B-2.2)チエニルスルホニルウレア、例えば(B-2.2.1)チフェンスルフロン-メチル;

(B-2.3)ピラゾリルスルホニルウレア、例えば(B-2.3.1)ピラゾスルフロン-エチル、(B-2.3.2)メチル ハロスルフロン-メチル、(B-2.3.3)メチル 5-(4,6-ジメチルピリミジン-2-イル-カルバモイルスルファモイル)-1-(2-ピリジル)ピラゾール-4-カルボキシレート(NC-330、Brighton Crop Prot. Conference Weeds 1991, 1, 45ff.を参照されたい)、(B-2.3.4)アジムスルフロン、(B-2.3.5)N

10

20

30

40

50

- [(4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) カルバモイル] - 4 - (5 , 5 - ジメチル - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - スルホンアミド ;

(B - 2 . 4) スルホンジアミド誘導体、例えば (B - 2 . 4 . 1) アミドスルフロンおよび (B - 2 . 4 . 2) その構造類似体 (E P - A 0 1 3 1 2 5 8 および Z . P f l . K r a n k h . P f l . S c h u t z , s p e c i a l i s s u e X I I , 4 8 9 - 4 9 7 (1 9 9 0)) ;

(B - 2 . 5) ピリジルスルホニルウレア、例えば (B - 2 . 5 . 1) ニコスルフロン、(B - 2 . 5 . 2) リムスルフロン、(B - 2 . 5 . 3) フルピルスルフロン - メチル、(B - 2 . 5 . 4) フルピルスルフロン - メチル - ナトリウム、(B - 2 . 5 . 5) 3 - (4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) - 1 - (3 - N - メチルスルホニル - N - メチルアミノピリジン - 2 - イル) スルホニルウレアまたはその塩 (D E - A 4 0 0 0 5 0 3 および D E - A 4 0 3 0 5 7 7)、(B - 2 . 5 . 6) フラザスルフロン、(B - 2 . 5 . 7) トリフロキシスルフロン - ナトリウム、(B - 2 . 5 . 8) フルセトスルフロン ;

(B - 2 . 6) アルコキシフェノキシスルホニルウレア、例えば (B - 2 . 6 . 1) エトキシスルフロンまたは (B - 2 . 6 . 2) その塩 ;

(B - 2 . 7) イミダゾリルスルホニルウレア、例えば (B - 2 . 7 . 1) スルホスルフロン、(B - 2 . 7 . 2) イマゾスルフロン、(B - 2 . 7 . 3) 2 - クロロ - N - [(4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) カルバモイル] - 6 - プロピルイミダゾ [1 , 2 - b] ピリダジン - 3 - スルホンアミド ;

(B - 2 . 8) フェニルアミノスルホニルウレア、例えば (B - 2 . 8 . 1) シクロスルファミロン、(B - 2 . 8 . 2) オルトスルファミロン ;

(B - 3) クロロアセトアニリド、例えば (B - 3 . 1) アセトクロル、(B - 3 . 1) アラクロル、(B - 3 . 2) ブタクロル、(B - 3 . 3) ジメタクロル、(B - 3 . 4) ジメテナミド、(B - 3 . 5) ジメテナミド - P メタザクロル、(B - 3 . 6) メトラクロル、(B - 3 . 7) S - メトラクロル、(B - 3 . 8) ペトキサミド、(B - 3 . 9) プレチラクロル、(B - 3 . 1 0) プロパクロル、(B - 3 . 1 1) プロピソクロルおよび (B - 3 . 1 2) テニルクロル ;

(B - 4) チオカルバメート、例えば (B - 4 . 1) S - エチル N , N - ジプロピルチオカルバメート (E P T C)、(B - 4 . 2) S - エチル N , N - ジイソブチルチオカルバメート (ブチレート)、(B - 4 . 3) シクロエート、(B - 4 . 4) ジメピペレート、(B - 4 . 5) エスプロカルブ、(B - 4 . 6) モリネート、(B - 4 . 7) オルベンカルブ、(B - 4 . 8) ペブレート、(B - 4 . 9) プロスルホカルブ、(B - 4 . 1 0) チオベンカルブ、(B - 4 . 1 1) チオカルバジル、(B - 4 . 1 2) トリアレートおよび (B - 4 . 1 3) ベルノレート ;

(B - 5) シクロヘキサンジオンオキシム、例えば (B - 5 . 1) アロキシジム、(B - 5 . 2) ブトロキシジム、(B - 5 . 3) クレトジム、(B - 5 . 4) クロプロキシジム、(B - 5 . 5) シクロキシジム、(B - 5 . 6) プロホキシジム、(B - 5 . 7) セトキシジム、(B - 5 . 8) テブラロキシジムおよび (B - 5 . 9) トラルコキシジム ;

(B - 6) イミダゾリノン、例えば (B - 6 . 1) イマザメタベンズ - メチル、(B - 6 . 2) イマザピック、(B - 6 . 3) イマザモックス、(B - 6 . 4) イマザピル、(B - 6 . 5) イマザキンおよび (B - 6 . 6) イマゼタピル ;

(B - 7) トリアゾロピリミジンスルホンアミド誘導体、例えば (B - 7 . 1) クロランスラム - メチル、(B - 7 . 2) ジクロスラム、(B - 7 . 3) フロラスラム、(B - 7 . 4) フルメツラム、(B - 7 . 5) メトスラム、(B - 7 . 6) ペノクススラム (B - 7 . 7) およびピロクススラム ;

(B - 8) ベンゾイルシクロヘキサンジオン、例えば (B - 8 . 1) スルコトリオン、(B - 8 . 2) 2 - (2 - ニトロベンゾイル) - 4 , 4 - ジメチルシクロヘキサン - 1 , 3 - ジオン (E P - A 0 2 7 4 6 3 4)、(B - 8 . 3) 2 - (2 - ニトロ - 3 - メチルス

10

20

30

40

50

ルホニルベンゾイル) - 4, 4 - ジメチルシクロヘキサン - 1, 3 - ジオン (WO 91 / 13548)、(B - 8.4) メソトリオン、(B - 8.5) 2 - [2 - クロロ - 3 - (5 - シアノメチル - 4, 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 4 - (エチルスルホニル) ベンゾイル] - 1, 3 - シクロヘキサンジオン、(B - 8.6) 2 - [2 - クロロ - 3 - (5 - シアノメチル - 4, 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 4 - (メチルスルホニル) ベンゾイル] - 1, 3 - シクロヘキサンジオン、(B - 8.7) 2 - [2 - クロロ - 3 - (5 - エトキシメチル - 4, 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 4 - (エチルスルホニル) ベンゾイル] - 1, 3 - シクロヘキサンジオン、(B - 8.8) 2 - [2 - クロロ - 3 - (5 - エトキシメチル - 4, 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 4 - (メチルスルホニル) ベンゾイル] - 1, 3 - シクロヘキサンジオン、(B - 8.9) 2 - [2 - クロロ - 3 - [(2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) メチル] - 4 - (エチルスルホニル) ベンゾイル] - 1, 3 - シクロヘキサンジオン、(B - 8.10) テンボトリオン、(B - 8.11) 2 - [2 - クロロ - 3 - [(2, 2 - ジフルオロエトキシ) メチル] - 4 - (エチルスルホニル) ベンゾイル] - 1, 3 - シクロヘキサンジオン、(B - 8.12) 2 - [2 - クロロ - 3 - [(2, 2 - ジフルオロエトキシ) メチル] - 4 - (メチルスルホニル) ベンゾイル] - 1, 3 - シクロヘキサンジオン、(B - 8.13) 2 - [2 - クロロ - 3 - [(2, 2, 3, 3 - テトラフルオロプロポキシ) メチル] - 4 - (エチルスルホニル) ベンゾイル] - 1, 3 - シクロヘキサンジオン、(B - 8.14) 2 - [2 - クロロ - 3 - [(2, 2, 3, 3 - テトラフルオロプロポキシ) メチル] - 4 - (メチルスルホニル) ベンゾイル] - 1, 3 - シクロヘキサンジオン、(B - 8.15) 2 - [2 - クロロ - 3 - (シクロプロピルメトキシ) - 4 - (エチルスルホニル) ベンゾイル] - 1, 3 - シクロヘキサンジオン、(B - 8.16) 2 - [2 - クロロ - 3 - (シクロプロピルメトキシ) - 4 - (メチルスルホニル) ベンゾイル] - 1, 3 - シクロヘキサンジオン、(B - 8.17) 2 - [2 - クロロ - 3 - (テトラヒドロフラン - 2 - イルメトキシメチル) - 4 - (エチルスルホニル) ベンゾイル] - 1, 3 - シクロヘキサンジオン、(B - 8.18) テフリルトリオン、(B - 8.19) 2 - [2 - クロロ - 3 - [2 - (2 - メトキシエトキシ) エトキシメチル] - 4 - (エチルスルホニル) ベンゾイル] - 1, 3 - シクロヘキサンジオン、(B - 8.20) 2 - [2 - クロロ - 3 - [2 - (2 - メトキシエトキシ) エトキシメチル] - 4 - (メチルスルホニル) ベンゾイル] - 1, 3 - シクロヘキサンジオン、(B - 8.21) 3 - ({2 - [(2 - メトキシエトキシ) メチル] - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル} カルボニル) ビシクロ [3.2.1] オクタン - 2, 4 - ジオン (WO 2001094339) ;

(B - 9) ベンゾイルイソキサゾール、例えば (B - 9.1) イソキサフルトール、(B - 9.2) イソキサクロール ;

(B - 10) ベンゾイルピラゾール、例えば (B - 10.1) ベンゾフェナップ、(B - 10.2) ピラゾリネート、(B - 10.3) ピラゾキシフェン、(B - 10.4) 5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 4 - [2 - (メチルスルホニル) - 4 - トリフルオロメチルベンゾイル] ピラゾール (WO 01 / 74785)、(B - 10.5) 1 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 4 - [2 - (メチルスルホニル) - 4 - トリフルオロメチルベンゾイル] ピラゾール (WO 01 / 74785)、(B - 10.6) 1, 3 - ジメチル - 5 - ヒドロキシ - 4 - [2 - (メチルスルホニル) - 4 - トリフルオロメチルベンゾイル] ピラゾール (WO 01 / 74785)、(B - 10.7) ピラスルホトール、(B - 10.8) 5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 4 - [2 - クロロ - 3 - (4, 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 4 - メチルスルホニルベンゾイル] ピラゾール (WO 99 / 58509)、(B - 10.9) トプラメゾン、(B - 10.10) 1 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 3 - メチル - 4 - [2 - メチル - 4 - メチルスルホニル - 3 - (2 - メトキシエチルアミノ) ベンゾイル] ピラゾール (WO 96 / 26206)、(B - 10.11) 3 - シクロプロピル - 5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 4 - [2 - メチル - 4 - メチルスルホニル - 3 - (2 - メトキシエチルアミノ) ベンゾイル] ピラゾール (WO 96 / 26206)、(B -

10

20

30

40

50

10 . 12) 5 - ベンゾキシ - 1 - エチル - 4 - [2 - メチル - 4 - メチルスルホニル -
 3 - (2 - メトキシエチルアミノ) ベンゾイル] ピラゾール (WO 96 / 26206) 、
 (B - 10 . 13) 1 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 4 - (3 - ジメチルアミノ - 2 - メチ
 ル - 4 - メチルスルホニルベンゾイル) ピラゾール (WO 96 / 26206) 、 (B - 1
 0 . 14) 5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 4 - (2 - クロロ - 3 - ジメチルアミノ - 4 -
 メチルスルホニルベンゾイル) ピラゾール (WO 96 / 26206) 、 (B - 10 . 15
) 1 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 4 - (3 - アリルアミノ - 2 - クロロ - 4 - メチルスル
 ホニルベンゾイル) ピラゾール (WO 96 / 26206) 、 (B - 10 . 16) 1 - エチ
 ル - 5 - ヒドロキシ - 4 - (2 - メチル - 4 - メチルスルホニル - 3 - モルフォリノベン
 ゾイル) ピラゾール (WO 96 / 26206) 、 (B - 10 . 17) 5 - ヒドロキシ - 1
 - イソプロピル - 4 - (2 - クロロ - 4 - メチルスルホニル - 3 - モルフォリノベンゾイ
 ル) ピラゾール (WO 96 / 26206) 、 (B - 10 . 18) 3 - シクロプロピル - 5
 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 4 - (2 - クロロ - 4 - メチルスルホニル - 3 - モルフォリ
 ノベンゾイル) ピラゾール (WO 96 / 26206) 、 (B - 10 . 19) 1 , 3 - ジメ
 チル - 5 - ヒドロキシ - 4 - (2 - クロロ - 4 - メチルスルホニル - 3 - ピラゾール - 1
 - イルベンゾイル) ピラゾール (WO 96 / 26206) 、 (B - 10 . 20) 1 - エチ
 ル - 5 - ヒドロキシ - 3 - メチル - 4 - (2 - クロロ - 4 - メチルスルホニル - 3 - ピラ
 ザール - 1 - イルベンゾイル) ピラゾール (WO 96 / 26206) 、 (B - 10 . 21
) 1 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 4 - (2 - クロロ - 4 - メチルスルホニル - 3 - ピラ
 ザール - 1 - イルベンゾイル) ピラゾール (WO 96 / 26206) 、 (B - 10 . 22)
 (5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) (3 , 3 , 4 - トリメチ
 ル - 1 , 1 - ジオキシド - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 - ベンゾチエン - 5 - イル) メタノン (
 US 2002 / 0016262) 、 (B - 10 . 23) 1 - メチル - 4 - [(3 , 3 , 4
 - トリメチル - 1 , 1 - ジオキシド - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 - ベンゾチエン - 5 - イル)
 カルボニル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イルプロパン - 1 - スルホネート (WO 2002
 / 015695) 、 (B - 10 . 24) ベンゾビシクロン ;
 (B - 11) スルホニルアミノカルボニルトリアゾリノン、 (B - 11 . 1) フルカルバ
 ザン - ナトリウム、 (B - 11 . 2) プロボキシカルバゾン、 (B - 11 . 3) プロボキ
 シカルバゾン - ナトリウム、 (B - 11 . 4) チエンカルバゾン - メチル ;
 (B - 12) トリアゾリノン、例えば (B - 12 . 1) アミカルバゾン、 (B - 12 . 2
) アザフェニジン、 (B - 12 . 3) カルフェントラゾン - エチル、 (B - 12 . 4) ス
 ルフェントラゾン、 (B - 12 . 5) ベンカルバゾン ;
 (B - 13) ホスフィン酸および誘導体、例えば (B - 13 . 1) ビラナホス、 (B - 1
 3 . 2) グルホシネート、 (B - 13 . 3) グルホシネート - アンモニウム ;
 (B - 14) グリシン誘導体、例えば (B - 14 . 1) グリホサート、 (B - 14 . 2)
 グリホサート - ナトリウム、 (B - 14 . 3) グリホサート - イソプロピルアンモニウム
 、 N - (ホスホノメチル) グリシントリメシウム塩 (スルホサート) ;
 (B - 15) ピリミジニルオキシピリジンカルボン酸誘導体およびピリミジニルオキシ安
 息香酸誘導体、例えば (B - 15 . 1) ベンジル 3 - (4 , 6 - ジメトキシピリミジン
 - 2 - イル) オキシピリジン - 2 - カルボキシレート (EP - A 0249707) 、 (B
 - 15 . 2) メチル 3 - (4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) オキシピリジン
 - 2 - カルボキシレート (EP - A 0249707) 、 (B - 15 . 3) 1 - (エトキシ
 カルボニルオキシエチル) 2 , 6 - ビス [(4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル)
 オキシ] ベンゾエート (EP - A 0472113) 、 (B - 15 . 4) ビスピリバック -
 ナトリウム、 (B - 15 . 5) ピリバムベンズ - イソプロピル、 (B - 15 . 6) ピリバ
 ムベンズ - プロピル、 (B - 15 . 7) ピリベンゾキシム、 (B - 15 . 8) ピリフタリ
 ド、 (B - 15 . 9) ピリミノバック - メチル、 (B - 15 . 10) ピリチオバック - ナ
 トリウム、 (B - 15 . 11) ピリミスルファン ;
 (B - 16) S - (N - アリール - N - アルキルカルバモイルメチル) ジチオホスホン酸
 エステル、例えば (B - 16 . 1) アニロホスなど ;

10

20

30

40

50

(B - 17) トリアジノン、例えば (B - 17 . 1) ヘキサジノン、(B - 17 . 2) メタミトロン、(B - 17 . 3) メトリブジン；

(B - 18) ピリジンカルボン酸、例えば (B - 18 . 1) アミノピラリド、(B - 18 . 2) クロピラリド、(B - 18 . 3) フルロキシピル、(B - 18 . 4) ピクロラムおよび (B - 18 . 5) トリクロピル；

(B - 19) ピリジン、例えば (B - 19 . 1) ジチオピルおよび (B - 19 . 2) チアゾピル；

(B - 20) ピリジンカルボキサミド、例えば (B - 20 . 1) ジフルフェニカンおよび (B - 20 . 1) ピコリナフェン；

(B - 21) 1 , 3 , 5 - トリアジン、例えば (B - 21 . 1) アメトリン、(B - 21 . 2) アトラジン、(B - 21 . 3) シアナジン、(B - 21 . 4) ジメタメトリン、(B - 21 . 5) プロメトン、(B - 21 . 6) プロメトリン、(B - 21 . 7) プロバジン、(B - 21 . 8) シマジン、(B - 21 . 9) シメトリン、(B - 21 . 10) テルブメトン、(B - 21 . 11) テルブチラジン、(B - 21 . 12) テルブトリンおよび (B - 21 . 13) トリエタジン；

(B - 22) ケトエノール、例えば (B - 22 . 1) ピノキサデン；

(B - 23) ピラゾール、例えば (B - 23 . 1) ピロキサスルホン。

【 0015 】

グループ (B - 1) から (B - 23) の除草剤は、例えば、上述の各刊行物から、および “ The Pesticide Manual ” , The British Crop Protection Council , 14th Edition , 2006 または e - Pesticide Manual , Version 4.0 , British Crop Protection Council 2006 から、あるいは “ Compendium of Pesticide Common Names ” から公知である。

【 0016 】

構造タイプに従って上で収載されている除草剤のうちのいくつかはまた、それがそれらの作用様式に帰する場合に構造重畳 (structure - overlapping) 特性を共有し、およびいくつかはまた、式 (I) の N - シクロプロピル - N - [置換 - ベンジル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドまたはチオカルボキサミド誘導体との組み合わせ中でのそれらの挙動に関して互いに類似している。

【 0017 】

式 (I) の N - シクロプロピル - N - [置換 - ベンジル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドまたはチオカルボキサミド誘導体と組み合わせることができるグループ (B) の好適な除草剤は、とりわけ好ましくは、以下よりなる群から選択されるものである。

【 0018 】

(B - A) 数日または数週間の期間にわたって有害作用が現れる除草剤、例えば (B - A . 1) クロロフィルの形成を防ぐまたは阻害する除草剤 (白化剤として作用する除草剤)、例えば

(B - A . 1 . 1) ヒドロキシフェニルピルベートジオキシゲナーゼの阻害剤 (HPPD 阻害剤)、例えば (B - A . 1 . 1 . 1) スルコトリオン、(B - A . 1 . 1 . 2) 2 - (2 - ニトロベンゾイル) - 4 , 4 - ジメチルシクロヘキサン - 1 , 3 - ジオン (EP - A0274634)、(B - A . 1 . 1 . 3) 2 - (2 - ニトロ - 3 - メチルスルホニルベンゾイル) - 4 , 4 - ジメチルシクロヘキサン - 1 , 3 - ジオン (WO91 / 13548)、(B - A . 1 . 1 . 4) メソトリオン、(B - A . 1 . 1 . 5) 2 - [2 - クロロ - 3 - (5 - シアノメチル - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 4 - (エチルスルホニル) ベンゾイル] - 1 , 3 - シクロヘキサンジオン、(B - A . 1 . 1 . 6) 2 - [2 - クロロ - 3 - (5 - シアノメチル - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 4 - (メチルスルホニル) ベンゾイル] - 1 , 3 - シクロヘキサンジオン、(B -

10

20

30

40

50

A . 1 . 1 . 7) 2 - [2 - クロロ - 3 - (5 - エトキシメチル - 4 , 5 - ジヒドロイソ
 キサゾール - 3 - イル) - 4 - (エチルスルホニル) ベンゾイル] - 1 , 3 - シクロヘキ
 サンジオン、 (B - A . 1 . 1 . 8) 2 - [2 - クロロ - 3 - (5 - エトキシメチル - 4
 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 4 - (メチルスルホニル) ベンゾイル] -
 1 , 3 - シクロヘキササンジオン、 (B - A . 1 . 1 . 9) 2 - [2 - クロロ - 3 - [(2
 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) メチル] - 4 - (エチルスルホニル) ベンゾイル] -
 1 , 3 - シクロヘキササンジオン、 (B - A . 1 . 1 . 10) テンボトリオン、 (B - A .
 1 . 1 . 11) 2 - [2 - クロロ - 3 - [(2 , 2 - ジフルオロエトキシ) メチル] - 4
 - (エチルスルホニル) ベンゾイル] - 1 , 3 - シクロヘキササンジオン、 (B - A . 1 .
 1 . 12) 2 - [2 - クロロ - 3 - [(2 , 2 - ジフルオロエトキシ) メチル] - 4 - (10
 メチルスルホニル) ベンゾイル] - 1 , 3 - シクロヘキササンジオン、 (B - A . 1 . 1 .
 13) 2 - [2 - クロロ - 3 - [(2 , 2 , 3 , 3 - テトラフルオロプロポキシ) メチル
] - 4 - (エチルスルホニル) ベンゾイル] - 1 , 3 - シクロヘキササンジオン、 (B - A
 . 1 . 1 . 14) 2 - [2 - クロロ - 3 - [(2 , 2 , 3 , 3 - テトラフルオロプロポキシ)
 メチル] - 4 - (メチルスルホニル) ベンゾイル] - 1 , 3 - シクロヘキササンジオン、
 (B - A . 1 . 1 . 15) 2 - [2 - クロロ - 3 - (シクロプロピルメトキシ) - 4 -
 (エチルスルホニル) ベンゾイル] - 1 , 3 - シクロヘキササンジオン、 (B - A . 1 . 1
 . 16) 2 - [2 - クロロ - 3 - (シクロプロピルメトキシ) - 4 - (メチルスルホニル)
 ベンゾイル] - 1 , 3 - シクロヘキササンジオン、 (B - A . 1 . 1 . 17) 2 - [2 -
 クロロ - 3 - (テトラヒドロフラン - 2 - イルメトキシメチル) - 4 - (エチルスルホニル)
 ベンゾイル] - 1 , 3 - シクロヘキササンジオン、 (B - A . 1 . 1 . 18) 2 - [2
 - クロロ - 3 - (テトラヒドロフラン - 2 - イルメトキシメチル) - 4 - (メチルスルホ
 ニル) ベンゾイル] - 1 , 3 - シクロヘキササンジオン (テフリルトリオン)、 (B - A .
 1 . 1 . 19) 2 - [2 - クロロ - 3 - [2 - (2 - メトキシエトキシ) - エトキシメチ
 ル] - 4 - (エチルスルホニル) ベンゾイル] - 1 , 3 - シクロヘキササンジオン、 (B -
 A . 1 . 1 . 20) 2 - [2 - クロロ - 3 - [2 - (2 - メトキシエトキシ) - エトキシ
 メチル] - 4 - (メチルスルホニル) ベンゾイル] - 1 , 3 - シクロヘキササンジオン、 (B
 - A . 1 . 1 . 21) 3 - ({ 2 - [(2 - メトキシエトキシ) メチル] - 6 - (トリ
 フルオロメチル) ピリジン - 3 - イル } カルボニル) ビシクロ [3 . 2 . 1] オクタン -
 2 , 4 - ジオン (WO 2001094339)、 (B - A . 1 . 1 . 22) イソキサフル 30
 トール、 (B - A . 1 . 1 . 23) ベンゾフェナップ、 (B - A . 1 . 1 . 24) ピラゾ
 リネート、 (B - A . 1 . 1 . 25) ピラゾキシフェン、 (B - A . 1 . 1 . 26) 5 -
 ヒドロキシ - 1 - メチル - 4 - [2 - (メチルスルホニル) - 4 - トリフルオロメチルベ
 ンゾイル] ピラゾール (WO 01 / 74785)、 (B - A . 1 . 1 . 27) 1 - エチル
 - 5 - ヒドロキシ - 4 - [2 - (メチルスルホニル) - 4 - トリフルオロメチルベンゾイ
 ル] ピラゾール (WO 01 / 74785)、 (B - A . 1 . 1 . 28) 1 , 3 - ジメチル
 - 5 - ヒドロキシ - 4 - [2 - (メチルスルホニル) - 4 - トリフルオロメチルベンゾイ
 ル] ピラゾール (WO 01 / 74785)、 (B - A . 1 . 1 . 29) ピラスルホトール
 、 (B - A . 1 . 1 . 30) 5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 4 - [2 - クロロ - 3 - (4
 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 4 - メチルスルホニルベンゾイル] ピラゾ 40
 ール (WO 99 / 58509)、 (B - A . 1 . 1 . 31) 5 - ヒドロキシ - 1 - メチル
 - 4 - [3 - (4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 2 - メチル - 4 - メチル
 スルホニルベンゾイル] ピラゾール (WO 99 / 58509)、 (B - A . 1 . 1 . 32)
) トブラメゾン、 (B - A . 1 . 1 . 33) 3 - シクロプロピル - 5 - ヒドロキシ - 1 -
 メチル - 4 - [2 - メチル - 4 - メチルスルホニル - 3 - (2 - メトキシエチルアミノ)
 ベンゾイル] ピラゾール (WO 96 / 26206)、 (B - A . 1 . 1 . 34) 5 - ベン
 ゴキシ - 1 - エチル - 4 - [2 - メチル - 4 - メチルスルホニル - 3 - (2 - メトキシエ
 チルアミノ) ベンゾイル] ピラゾール (WO 96 / 26206)、 (B - A . 1 . 1 . 35)
 1 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 4 - (3 - ジメチルアミノ - 2 - メチル - 4 - メチル
 スルホニルベンゾイル) ピラゾール (WO 96 / 26206)、 (B - A . 1 . 1 . 36 50

) 5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 4 - (2 - クロロ - 3 - ジメチルアミノ - 4 - メチルスルホニルベンゾイル) ピラゾール (WO 9 6 / 2 6 2 0 6)、(B - A . 1 . 1 . 3 7)
 1 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 4 - (3 - アリルアミノ - 2 - クロロ - 4 - メチルスルホニルベンゾイル) ピラゾール (WO 9 6 / 2 6 2 0 6)、(B - A . 1 . 1 . 3 8) 1 -
 エチル - 5 - ヒドロキシ - 4 - (2 - メチル - 4 - メチルスルホニル - 3 - モルフォリノベンゾイル) ピラゾール (WO 9 6 / 2 6 2 0 6)、(B - A . 1 . 1 . 3 9) 5 - ヒドロ
 キシ - 1 - イソプロピル - 4 - (2 - クロロ - 4 - メチルスルホニル - 3 - モルフォリノベンゾイル) ピラゾール (WO 9 6 / 2 6 2 0 6)、(B - A . 1 . 1 . 4 0) 3 - シク
 ロプロピル - 5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 4 - (2 - クロロ - 4 - メチルスルホニル - 3 - モルフォリノベンゾイル) ピラゾール (WO 9 6 / 2 6 2 0 6)、(B - A . 1 . 1 . 4 1) 1 , 3 - ジメチル - 5 - ヒドロキシ - 4 - (2 - クロロ - 4 - メチルスルホニル - 3 -
 ピラゾール - 1 - イルベンゾイル) ピラゾール (WO 9 6 / 2 6 2 0 6)、(B - A . 1 . 1 . 4 2) 1 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 3 - メチル - 4 - (2 - クロロ - 4 -
 メチルスルホニル - 3 - ピラゾール - 1 - イル - ベンゾイル) ピラゾール (WO 9 6 / 2 6 2 0 6)、(B - A . 1 . 1 . 4 3) 1 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 4 - (2 - クロロ - 4 -
 メチルスルホニル - 3 - ピラゾール - 1 - イルベンゾイル) ピラゾール (WO 9 6 / 2 6 2 0 6)、(B - A . 1 . 1 . 4 4) (5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 1 H - ピラ
 ザール - 4 - イル) (3 , 3 , 4 - トリメチル - 1 , 1 - ジオキシド - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 - ベンゾチエン - 5 - イル) メタノン (US - A 2 0 0 2 / 0 0 1 6 2 6 2)、(B
 - A . 1 . 1 . 4 5) 1 - メチル - 4 - [(3 , 3 , 4 - トリメチル - 1 , 1 - ジオキシド - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 - ベンゾチエン - 5 - イル) カルボニル] - 1 H - ピラゾール
 - 5 - イルプロパン - 1 - スルホネート (WO 2 0 0 2 / 0 1 5 6 9 5)、(B - A . 1 . 1 . 4 6) ベンゾピシクロンおよび (B - A . 1 . 1 . 4 7) イソキサクロルトールな
 ど ;

(B - A . 1 . 2) フィトエンデサチュラーゼ阻害剤を包含するカロテノイド生合成の阻
 害剤、例えば (B - A . 1 . 2 . 1) ノルフルラゾン、(B - A . 1 . 2 . 2) ベフルブ
 タミド、(B - A . 1 . 2 . 3) フルリドン、(B - A . 1 . 2 . 4) フルロクロリドン
 、(B - A . 1 . 2 . 5) フルルタモン、(B - A . 1 . 2 . 6) アミトロール、(B -
 A . 1 . 2 . 7) クロマゾン、(B - A . 1 . 2 . 8) アクロニフェン、(B - A . 1 .
 2 . 9) ジフルフェニカンおよび (B - A . 1 . 2 . 1 0) ピコリナフェンなど、
 (B - A . 1 . 3) ジヒドロプテロエートシンターゼ (D H P シンターゼ) の阻害剤、例
 えば (B - A . 1 . 3 . 1) アシュラムなど ;

(B - A . 2) アミノ酸合成を妨げる除草剤、例えば

(B - A . 2 . 1) 植物中のアセトラクテートシンターゼの阻害剤、例えば、(B - A .
 2 . 1 . 1) クロルスルフロン、(B - A . 2 . 1 . 2) クロリムロン - エチル、(B -
 A . 2 . 1 . 3) メトスルフロン - メチル、(B - A . 2 . 1 . 4) トリアスルフロン、
 (B - A . 2 . 1 . 5) スルホメツロン - メチル、(B - A . 2 . 1 . 6) トリベヌロン
 - メチル、(B - A . 2 . 1 . 7) ベンスルフロン - メチル、(B - A . 2 . 1 . 8) プ
 リミスルフロン - メチル、(B - A . 2 . 1 . 9) 3 - (4 - エチル - 6 - メトキシ - 1
 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イル) - 1 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 1 - ジオキソ - 2 -
 メチルベンゾ - [b] チオフェン - 7 - スルホニル) ウレア (EP - A 0 7 9 6 8 3)、
 (B - A . 2 . 1 . 1 0) 3 - (4 - エトキシ - 6 - エチル - 1 , 3 , 5 - トリアジン -
 2 - イル) - 1 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 1 - ジオキソ - 2 - メチルベンゾ [b] - チ
 オフェン - 7 - スルホニル) ウレア (EP - A 0 0 7 9 6 8 3)、(B - A . 2 . 1 . 1
 1) 3 - (4 - メトキシ - 6 - メチル - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イル) - 1 - (2
 - メトキシカルボニル - 5 - ヨードフェニルスルホニル) ウレア (WO 9 2 / 1 3 8 4 5
)、(B - A . 2 . 1 . 1 1 a) 化合物 (B - A . 2 . 1 . 1 1) の農業的に有用な塩、
 (B - A . 2 . 1 . 1 1 b) ヨードスルフロン - メチル - ナトリウム、(B - A . 2 . 1
 . 1 2) トリフルスルフロン - メチル、(B - A . 2 . 1 . 1 3) オキサスルフロン、(B
 - A . 2 . 1 . 1 4) メソスルフロン - メチル、(B - A . 2 . 1 . 1 4 a) 化合物 (

10

20

30

40

50

B - A . 2 . 1 . 1 4) の農業的に有用な塩、(B - A . 2 . 1 . 1 4 b) 化合物 (B - A . 2 . 1 . 1 4) のナトリウム塩、(B - A . 2 . 1 . 1 5) ホラムスルフロン、(B - A . 2 . 1 . 1 5 a) 化合物 (B - A . 2 . 1 . 1 5) の農業的に有用な塩、(B - A . 2 . 1 . 1 5 b) 化合物 (B - A . 2 . 1 . 1 5) のナトリウム塩、(B - A . 2 . 1 . 1 6) シノスルフロン、(B - A . 2 . 1 . 1 7) エタメトスルフロン - メチル、(B - A . 2 . 1 . 1 8) プロスルフロン、(B - A . 2 . 1 . 1 9) スルホメツロン - メチル、(B - A . 2 . 1 . 2 0) トリトスルフロン、(B - A . 2 . 1 . 2 1) モノスルフロン)、(B - A . 2 . 1 . 2 2) メチル 2 - [({ [4 - メトキシ - 6 - (メチルチオ) ピリミジン - 2 - イル] カルバモイル } アミノ) スルホニル] ベンゾエート、(B - A . 2 . 1 . 2 3) チフェンスルフロン - メチル、(B - A . 2 . 1 . 2 4) ピラゾスルフロン - エチル、(B - A . 2 . 1 . 2 5) ハロスルフロン - メチル、(B - A . 2 . 1 . 2 6) メチル 5 - (4 , 6 - ジメチルピリミジン - 2 - イルカルバモイルスルファモイル) - 1 - (2 - ピリジル) ピラゾール - 4 - カルボキシレート (NC - 3 3 0 、 B r i g h t o n C r o p P r o t . C o n f e r e n c e ' W e e d s ' 1 9 9 1 , V o l . 1 , p . 4 5 以下を参照されたい)、(B - A . 2 . 1 . 2 7) アジムスルフロン、(B - A . 2 . 1 . 2 8) N - [(4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) カルバモイル] - 4 - (5 , 5 - ジメチル - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 3 - イル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - スルホンアミド、(B - A . 2 . 1 . 2 9) アミドスルフロン、(B - A . 2 . 1 . 2 9 a) 化合物 (B - A . 2 . 1 . 2 9) の農業的に有用な塩、(B - A . 2 . 1 . 2 9 b) 化合物 (B - A . 2 . 1 . 2 9) のナトリウム塩、(B - A . 2 . 1 . 2 9 c) E P - A 0 1 3 1 2 5 8 および Z . P f l . K r a n k h . P f l . S c h u t z , s p e c i a l e d i t i o n X I I , 4 8 9 - 4 9 7 によるアミドスルフロンの構造類似体 (B - A 9 9 0)、(B - A . 2 . 1 . 3 0) ニコスルフロン、(B - A . 2 . 1 . 3 1) リムスルフロン)、(B - A . 2 . 1 . 3 2) フルピルスルフロン - メチル - ナトリウム、(B - A . 2 . 1 . 3 3) 3 - (4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) - 1 - (3 - N - メチルスルホニル - N - メチル - アミノピリジン - 2 - イル) スルホニルウレア (D E - A 4 0 0 0 5 0 3 および D E - A 4 0 3 0 5 7 7)、(B - A . 2 . 1 . 3 3 a) 化合物 (B - A . 2 . 1 . 3 3) の農業的に有用な塩、(B - A . 2 . 1 . 3 3 b) 化合物 (B - A . 2 . 1 . 3 3) のナトリウム塩、(B - A . 2 . 1 . 3 4) フラザスルフロン、(B - A . 2 . 1 . 3 5) トリフロキシスルフロン - ナトリウム、(B - A . 2 . 1 . 3 6) フルセトスルフロン、(B - A . 2 . 1 . 3 7) エトキシスルフロン、(B - A . 2 . 1 . 3 7 a) 化合物 (B - A . 2 . 1 . 3 7) の農業的に有用な塩、(B - A . 2 . 1 . 3 7 b) 化合物 (B - A . 2 . 1 . 3 7) のナトリウム塩、(B - A . 2 . 1 . 3 8) スルホスルフロン、(B - A . 2 . 1 . 3 9) イマゾスルフロン、(B - A . 2 . 1 . 4 0) 2 - クロロ - N - [(4 , 6 - ジメトキシピリミジン - 2 - イル) カルバモイル] - 6 - プロピルイミダゾ [1 , 2 - b] ピリダジン - 3 - スルホンアミド、(B - A . 2 . 1 . 4 1) シクロスルファミロン、(B - A . 2 . 1 . 4 2) オルトスルファミロン、(B - A . 2 . 1 . 4 3) イマザメタベンズ - メチル、(B - A . 2 . 1 . 4 4) イマザピク、(B - A . 2 . 1 . 4 5) イマザモックス、(B - A . 2 . 1 . 4 6) イマザピル、(B - A . 2 . 1 . 4 7) イマザキンおよび (B - A . 2 . 1 . 4 8) イマゼタピル、(B - A . 2 . 1 . 4 9) クロランスラム - メチル、(B - A . 2 . 1 . 5 0) ジクロスラム、(B - A . 2 . 1 . 5 1) フロラスラム、(B - A . 2 . 1 . 5 2) フルメツラム、(B - A . 2 . 1 . 5 3) メトスラム、(B - A . 2 . 1 . 5 4) ペノクススラム、(B - A . 2 . 1 . 5 5) ピロクススラム、(B - A . 2 . 1 . 5 6) 4 , 5 - ジヒドロ - 3 - メトキシ - 4 - メチル - 5 - オキソ - N - (2 - トリフルオロメトキシフェニルスルホニル) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - カルボキサミド、(B - A . 2 . 1 . 5 6 a) 化合物 (B - A . 2 . 1 . 5 6) の農業的に有用な塩、(B - A . 2 . 1 . 5 6 b) フルカルバゾン - ナトリウム、(B - A . 2 . 1 . 5 7) メチル 2 - (4 , 5 - ジヒドロ - 4 - メチル - 5 - オキソ - 3 - プロボキシ - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) カルボキサミドスルホニル

ベンゾエート、(B-A.2.1.57a)化合物(B-A.2.1.57)の農業的に有用な塩、(B-A.2.1.57b)プロボキシカルバゾン-ナトリウム、(B-A.2.1.58)チエンカルバゾン-メチル、(B-A.2.1.59)ベンジル 3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)オキシピリジン-2-カルボキシレート(EP-A0249707)、(B-A.2.1.60)メチル 3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-オキシピリジン-2-カルボキシレート(EP-A0249707)、(B-A.2.1.61)1-(エトキシカルボニルオキシエチル)2,6-ビス[(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)オキシ]ベンゾエート(EP-A0472113)、(B-A.2.1.62)2,6-ビス[(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)オキシ]安息香酸、(B-A.2.1.62a)化合物(B-A.2.1.62)の農業的に有用な塩、(B-A.2.1.62b)ビスピリバック-ナトリウム、(B-A.2.1.63)ピリバムベンズ-イソプロピル、(B-A.2.1.64)ピリバムベンズ-プロピル、(B-A.2.1.65)ピリベンゾキシム、(B-A.2.1.66)ピリフタリド、(B-A.2.1.67)ピリミノバック-メチル、(B-A.2.1.68)2-クロロ-6-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルチオ)安息香酸、(B-A.2.1.68a)化合物(B-A.2.1.68)の農業的に有用な塩、(B-A.2.1.68b)ピリチオバック-ナトリウム、および(B-A.2.1.69)ピリミスルファンなど；

10

(B-A.2.2)EPSPシンターゼの阻害剤、例えば、(B-A.2.2.1)グリホサート、(B-A.2.2.1a)化合物(B-A.2.2.1)の農業的に有用な塩、(B-A.2.2.1b)グリホサート-ナトリウム、(B-A.2.2.1c)グリホサート-イソプロピルアンモニウム、(B-A.2.2.2)スルホサートなど；

20

(B-A.2.3)グルタミンシンターゼの阻害剤、例えば、(B-A.2.3.1)ピアラホス(=ピラナホス)、(B-A.2.3.2)グルホシネート、(B-A.2.3.1a)化合物(B-A.2.3.1)の農業的に有用な塩、(B-A.2.3.1b)グルホシネート-ナトリウム塩、(B-A.2.3.1c)グルホシネート-アンモニウムなど；

(B-A.3)植物中の脂質合成の阻害剤、例えば、

(B-A.3.1)アセチル-コエンザイムAカルボキシラーゼ(ACCase)の阻害剤、例えば(B-A.3.1.1)ジクロホップ-メチル、(B-A.3.1.1a)ジクロホップ-P-メチル、(B-A.3.1.2)メチル 2-(4-(4-ブromo-2-クロロフェノキシ)フェノキシ)プロピオネート(DE-A2601548)、(B-A.3.1.3)メチル 2-(4-(4-ブromo-2-フルオロフェノキシ)フェノキシ)プロピオネート(US-A4,808,750)、(B-A.3.1.4)メチル 2-(4-(2-クロロ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェノキシ)プロピオネート(DE-A2433067)、(B-A.3.1.5)メチル 2-(4-(2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェノキシ)プロピオネート(US4,808,750)、(B-A.3.1.6)メチル 2-(4-(2,4-ジクロロベンジル)フェノキシ)プロピオネート(DE-A2417487)、(B-A.3.1.7)エチル 4-(4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェノキシ)ペンタ-2-エノエート、(B-A.3.1.8)メチル 2-(4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェノキシ)プロピオネート(DE-A2433067)、(B-A.3.1.9)シハロホップ-ブチル、(B-A.3.1.10)エチル 2-(4-(3,5-ジクロロピリジル-2-オキシ)フェノキシ)プロピオネート(EP-A0002925)、(B-A.3.1.11)プロパルギル 2-(4-(3,5-ジクロロピリジル-2-オキシ)フェノキシ)プロピオネート(EP-A0003114)、(B-A.3.1.12)ハロキシホップ、(B-A.3.1.12a)ハロキシホップ-メチル、(B-A.3.1.12b)ハロキシホップ-エトチル(etotyl)、(B-A.3.1.12c)ハロキシホップ-ナトリウム、(B-A.3.1.12d)ハロキシホップ-P、(B-A.3.1.12e)ハロキシホップ-P-メチル、(B-A.3.1.12f)

30

40

50

ハロキシホップ - P - エチル、(B - A . 3 . 1 . 1 2 g) ハロキシホップ - P - ナトリウム、(B - A . 3 . 1 . 1 3) エチル 2 - (4 - (3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジルオキシ) フェノキシ) プロピオネート (E P - A 0 0 0 3 8 9 0)、(B - A . 3 . 1 . 1 4) クロジナホップ - プロパルギル、(B - A . 3 . 1 . 1 5) フルアジホップ - ブチル、(B - A . 3 . 1 . 1 5 a) フルアジホップ - P - ブチル、(B - A . 3 . 1 . 1 6) (R) - 2 - [4 - (3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - 2 - ピリジルオキシ) フェノキシ] プロピオン酸、(B - A . 3 . 1 . 1 7) キザロホップ、(B - A . 3 . 1 . 1 7 a) キザロホップ - P、(B - A . 3 . 1 . 1 7 b) キザロホップ - エチル、(B - A . 3 . 1 . 1 7 c) キザロホップ - メチル、(B - A . 3 . 1 . 1 7 d) キザロホップ - テフリル、(B - A . 3 . 1 . 1 7 e) キザロホップ - P - エチル、(B - A . 3 . 1 . 1 7 f) キザロホップ - P - メチル、(B - A . 3 . 1 . 1 7 g) キザロホップ - P - テフリル、(B - A . 3 . 1 . 1 8) プロバキザホップ、(B - A . 3 . 1 . 1 9) メチル 2 - (4 - (6 - フルオロ - 2 キノキサリルオキシ) フェノキシ) プロピオネート (J . P e s t . S c i . 1 9 8 5 , 1 0 , 6 1 を参照されたい)、(B - A . 3 . 1 . 2 0) フェノキサプロップ、(B - A . 3 . 1 . 2 0 a) フェノキサプロップ - エチル、(B - A . 3 . 1 . 2 0 b) フェノキサプロップ - P、(B - A . 3 . 1 . 2 0 c) フェノキサプロップ - P - エチル、(B - A . 3 . 1 . 2 1) エチル 2 - (4 - (6 - クロロベンゾチアゾール - 2 - イルオキシ) フェノキシ) プロピオネート (D E - A - 2 6 4 0 7 3 0)、(B - A . 3 . 1 . 2 2) メタミホップ、(B - A . 3 . 1 . 2 3) アロキシジム (- ナトリウム)、(B - A . 3 . 1 . 2 4) ブトロキシジム、(B - A . 3 . 1 . 2 5) クレトジム、(B - A . 3 . 1 . 2 6) クロプロキシジム、(B - A . 3 . 1 . 2 7) シクロキシジム、(B - A . 3 . 1 . 2 8) プロホキシジム、(B - A . 3 . 1 . 2 9) セトキシジム、(B - A . 3 . 1 . 3 0) テブラロキシジム、(B - A . 3 . 1 . 3 1) トラルコキシジムおよび (B - A . 3 . 1 . 3 2) ピノキサデン ;

(B - A . 3 . 2) A C C a s e 阻害剤の作用メカニズムと異なる作用メカニズムを持つ脂質合成の阻害剤、例えば (B - A . 3 . 2 . 1) S - エチル N , N - ジプロピルチオカルバメート (E P T C)、(B - A . 3 . 2 . 2) S - エチル N , N - ジイソブチルチオカルバメート (ブチレート)、(B - A . 3 . 2 . 3) チオベンカルブ = ベンチオカルブ、(B - A . 3 . 2 . 4) シクロエート、(B - A . 3 . 2 . 5) ジメピペレート、(B - A . 3 . 2 . 6) エスプロカルブ、(B - A . 3 . 2 . 7) モリネート、(B - A . 3 . 2 . 8) オルベンカルブ、(B - A . 3 . 2 . 9) ペブレート、(B - A . 3 . 2 . 1 0) プロスルホカルブ、(B - A . 3 . 2 . 1 1) チオカルバジル、(B - A . 3 . 2 . 1 2) トリアレート、(B - A . 3 . 2 . 1 3) ベルノレート、(B - A . 3 . 2 . 1 4) ベンスリド、(B - A . 3 . 2 . 1 5) ベンフレセート、(B - A . 3 . 2 . 1 6) エトフメセート、(B - A . 3 . 2 . 1 7) T C A、(B - A . 3 . 2 . 1 8) ダラボンおよび (B - A . 3 . 2 . 1 9) フルプロパネートなど、

(B - A . 4) 細胞分裂および細胞発達の阻害剤、例えば

(B - A . 4 . 1) 細胞壁合成の阻害剤 (セルロース合成阻害剤)、例えば (B - A . 4 . 1 . 1) ジクロベニル、(B - A . 4 . 1 . 2) クロルチアミド、(B - A . 4 . 1 . 3) イソキサベン、(B - A . 4 . 1 . 4) フルボキサムおよび (B - A . 4 . 1 . 5) トリアジフラム ;

(B - A . 4 . 2) 微小管 (m i c r o t u b u l i) の阻害剤 (微小管の形成およびそれらの構築についての阻害剤)、例えば (B - A . 4 . 2 . 1) ベネフィン = ベンフルラリン、(B - A . 4 . 2 . 2) ブトラリン、(B - A . 4 . 2 . 3) ジニトラミン、(B - A . 4 . 2 . 4) エタルフルラリン、(B - A . 4 . 2 . 5) オリザリン、(B - A . 4 . 2 . 6) ペンジメタリン、(B - A . 4 . 2 . 7) トリフルラリン、(B - A . 4 . 2 . 8) アミプロホス - メチル、(B - A . 4 . 2 . 9) ブタミホス、(B - A . 4 . 2 . 1 0) プロピザミド = プロナミド、(B - A . 4 . 2 . 1 1) テブタム、(B - A . 4 . 2 . 1 2) D C P A = クロルタール - ジメチル、(B - A . 4 . 2 . 1 3) クロルプロ

10

20

30

40

50

ファム、(B-A.4.2.14)プロファム、(B-A.4.2.15)カルベタミド、(B-A.4.2.16)ジチオピルおよび(B-A.4.2.17)チアゾピルなど；

(B-A.4.3)有糸分裂または微小管構築の阻害剤、例えば(B-A.4.3.1)クロルプロファム、(B-A.4.3.2)プロファム、(B-A.4.3.3)カルベタミドなど；

(B-A.4.4)極長鎖脂肪酸(VLCFA)の合成の阻害剤、例えば(B-A.4.4.1)アセトクロル、(B-A.4.4.2)アラクロル、(B-A.4.4.3)ブタククロル、(B-A.4.4.4)ジメタククロル、(B-A.4.4.5)ジメテナミド、(B-A.4.4.6)メタザクロル、(B-A.4.4.7)メトラクロル、(B-A.4.4.8)S-メトラクロル、(B-A.4.4.9)ペトキサミド、(B-A.4.4.10)プレチクロル、(B-A.4.4.11)プロバクロル、(B-A.4.4.12)プロピソクロル、(B-A.4.4.13)テニルクロル、(B-A.4.4.14)ジフェナミド、(B-A.4.4.15)ナプロパミド、(B-A.4.4.16)ナプロアニリド、(B-A.4.4.17)フルフェナセット、(B-A.4.4.18)メフェナセット、(B-A.4.4.19)フェントラザミド、(B-A.4.4.20)カフェンストロール、(B-A.4.4.21)ピペロホス、(B-A.4.4.22)S-(N-アリアル-N-アルキルカルバモイルメチル)ジチオホスホネートおよび(B-A.4.4.22a)S-[N-(4-クロロフェニル)-N-イソプロピルカルバモイルメチル]O, O-ジメチルジチオホスフェート(アニロホス)など；

(B-A.5)光合成を攪乱する除草剤、例えば(B-A.5.1)光合成II系の阻害剤、例えば(B-A.5.1.1)デスメトリン、(B-A.5.1.2)プロマシル、(B-A.5.1.3)レナシル、(B-A.5.1.4)テルバシル、(B-A.5.1.5)ピラゾン=クロリダゾン、(B-A.5.1.6)デスメジファム、(B-A.5.1.7)フェンメジファム、(B-A.5.1.8)クロロブロムロン、(B-A.5.1.9)クロロトルロン、(B-A.5.1.10)クロロクスロン、(B-A.5.1.11)ジメフロム、(B-A.5.1.12)ジウロン、(B-A.5.1.13)エチジムロン、(B-A.5.1.14)フェヌロン、(B-A.5.1.15)フルオメツロン、(B-A.5.1.16)イソプロツロン、(B-A.5.1.17)イソウロン、(B-A.5.1.18)リヌロン、(B-A.5.1.19)メタベンズチアズロン、(B-A.5.1.20)メトブロムロン、(B-A.5.1.21)メトクスロン、(B-A.5.1.22)モノリヌロン、(B-A.5.1.23)ネブロン、(B-A.5.1.24)シデュロン、(B-A.5.1.25)テブチウロン、(B-A.5.1.26)プロパニル、(B-A.5.1.27)ペンタノクロル、(B-A.5.1.28)プロモフェノキシム、(B-A.5.1.29)プロモキシニル、(B-A.5.1.30)イオキシニル、(B-A.5.1.31)ペンタゾン、(B-A.5.1.32)ピリデート、(B-A.5.1.33)ピリダホル、(B-A.5.1.34)4-アミノ-N-tert-ブチル-4,5-ジヒドロ-3-イソプロピル-5-オキソ-1,2,4-1H-トリアゾール-1-カルボキサミド(アミカルバゾン)、(B-A.5.1.35)3-シクロヘキシル-6-ジメチルアミノ-1-メチル-1,3,5-トリアジン-2,4-(B-AH,3H)-ジオン(ヘキサジノン)、(B-A.5.1.36)4-アミノ-4,5-ジヒドロ-3-メチル-6-フェニル-1,2,4-トリアジン-5-オン(メタミトロン)、(B-A.5.1.37)4-アミノ-6-tert-ブチル-4,5-ジヒドロ-3-メチルチオ-1,2,4-トリアジン-5-オン(メトリブジン)、(B-A.5.1.38)アメトリン、(B-A.5.1.39)アトラジン、(B-A.5.1.40)シアナジン、(B-A.5.1.41)ジメタメトリン、(B-A.5.1.42)プロメトン、(B-A.5.1.43)プロメトリン、(B-A.5.1.44)プロパジン、(B-A.5.1.45)シマジン、(B-A.5.1.46)シメトリン、(B-A.5.1.47)テルブメトン、(B-A.5.1.48)テルブチラジン、(B-A.5.1.49)テルブトリンおよび(B-A.5.1.50)

10

20

30

40

50

1.50) トリエタジンなど；

(B-A.6) ホルモン様の効果により植物の発達に悪影響を与える除草剤、例えば (B-A.6.1) クロメプロップ、(B-A.6.2) 2,4-D、(B-A.6.3) 2,4-DB、(B-A.6.4) ジクロルプロップ = 2,4-DP、(B-A.6.5) MCPA、(B-A.6.6) MCPB、(B-A.6.7) メコプロップ = MCPP = CMP P、(B-A.6.8) クロランベン、(B-A.6.9) ジカンバ、(B-A.6.10) TBA、(B-A.6.11) キンクロラック、(B-A.6.12) キンメラック、(B-A.6.13) ベナゾリン - エチル、(B-A.6.14) ナブタラム、(B-A.6.15) ジフルフェンゾピル - Na、(B-A.6.16) アミノピラリド、(B-A.6.17) クロピラリド、(B-A.6.18) フルロキシピル (-メブチル)、(B-A.6.19) ピクロラム、(B-A.6.20) トリクロピル、(B-A.6.21) ホルクロルフェヌロンおよび (B-A.6.22) チジアズロンなど；

(B-A.7) 未だ確認されていない作用メカニズムを持つ除草剤、例えば (B-A.7.1) フラムプロップ - M - メチル / - イソプロピル、(B-A.7.2) ジフェンゾコート、(B-A.7.3) DSMA、(B-A.7.4) MSMA、(B-A.7.5) プロモブチド、(B-A.7.6) (クロロ) - フルレノール (-メチル)、(B-A.7.7) シンメチリン、(B-A.7.8) クミルロン、(B-A.7.9) ダゾメット、(B-A.7.10) ダイムロン (dymron) = ダイムロン (daimuron)、(B-A.7.11) メチル - ダイムロン (dimuron) = メチル - ダイムロン (dymron)、(B-A.7.12) エトベンザニド、(B-A.7.13) ホサミン、(B-A.7.14) インダノファン、(B-A.7.15) メタム、(B-A.7.16) オキサジクロメホンおよび (B-A.7.17) ピリブチカルブなど；

(B-B) 有害作用が迅速に発生する除草剤、例えば

(B-B.1) 光系 I 中の電子伝達に負の影響を与える除草剤、例えば (B-B.1.1) ジクワット、(B-B.1.1a) ジクワットジプロミド、(B-B.1.2) パラコート、(B-B.1.2a) パラコートジクロリドなど；

(B-B.2) プロトポルフィリンオキシダーゼの阻害剤、例えば (B-B.2.1) アシフルオルフェン - Na、(B-B.2.2) ビフェノックス、(B-B.2.3) クロメトキシフェン、(B-B.2.4) フルオログリコフェン - エチル、(B-B.2.5) ホメサフェン、(B-B.2.6) ハロサフェン、(B-B.2.7) ラクトフェン、(B-B.2.8) オキシフルオルフェン、(B-B.2.9) フルアゾレート、(B-B.2.10) ピラフルフェン - エチル、(B-B.2.11) シニドン / - メチル / - エチル、(B-B.2.12) フルミオキサジン、(B-B.2.13) フルミクロラック - ベンチル、(B-B.2.14) フルチアセット - メチル、(B-B.2.15) チジアジミン、(B-B.2.16) オキサジアゾン、(B-B.2.17) オキサジアルギル、(B-B.2.18) ペントキサゾン、(B-B.2.19) ベンズフェンジゾン、(B-B.2.20) プタフェナシル、(B-B.2.21) ピラクロニル、(B-B.2.22) プロフルアゾール、(B-B.2.23) フルフェンピル - エチル、(B-B.2.24) アザフェニジン、(B-B.2.25) カルフェントラゾン - エチル、(B-B.2.26) スルフェントラゾンおよび (B-B.2.27) ベンカルバゾンなど；

(B-B.3) 植物中の細胞膜を破壊するもの、例えば (B-B.3.1) DNO C、(B-B.3.2) ジノセブおよび (B-B.3.3) ジノテルブなど；

(B-B.4) 未知の作用メカニズムを持つ除草剤、例えば (B-B.4.1) オレイン酸および (B-B.4.2) ペラルゴン酸など。

【0019】

上述のグループ (B-A) および (B-B) ならびのそれらのサブグループの除草剤は、上述の各刊行物から公知であり、例えば、“The Pesticide Manual”, The British Crop Protection Council, 14th Edition, 2006 または対応する e-Pesticide Manual

10

20

30

40

50

l, version 4.0, British Crop Protection Council 2006 中で、あるいは“Compendium of Pesticide Common Names”(インターネットを介して入手可能) 中で、それらの化学名により、または商業的製品の場合は与えられた一般名により定義されている。

【0020】

商業的活性化合物が、好ましくは、述べられた化合物の特別な塩またはエステル形態で存在する場合、化合物への参照はまた、好ましくは、このことが同様に述べられていなくとも慣例的な商業形態を包含する。

【0021】

いくつかの場合において、除草剤グループ(B-A)および(B-B)ならびにそれらのサブグループは、様々な構造分類からの活性化合物を含む。言及されたグループ(B-A)および(B-B)のグループまたはサブグループのうちの同じ構造分類からの各除草剤は、それゆえに、各々の場合において、各作用メカニズムグループまたは現象的グループ内でより好ましいサブグループを形成する。

【0022】

好ましいのは、化合物(A1)、(A2)、(A3)、(A4)、(A5)、(A6)、(A7)、(A8)、(A9)、(A10)、(A11)、(A12)、(A13)、(A14)、(A15)、(A16)、(A17)、(A18)、(A19)または(A20)と、除草剤グループ(B-A)、(B-A.1)、(B-A.1.1)、(B-A.1.2)、(B-A.1.3)、(B-A.2)、(B-A.2.1)、(B-A.2.2)、(B-A.3)、(B-A.3.1)、(B-A.3.2)、(B-A.4)、(B-A.4.1)、(B-A.4.2)、(B-A.4.3)、(B-A.4.4)、(B-A.5)、(B-A.5.1)、(B-A.6)、(B-A.7)、(B-B)、(B-B.1)、(B-B.2)、(B-B.3)または(B-B.4)の群からの1または複数の活性化合物との組み合わせを含む組成物の使用である。

【0023】

グループ(C):

好適な植物成長調節物質(PGR)は、植物またはそれらの果実の発芽、成長、成熟および熟成または発達に対して影響を持ち得る化合物または混合物である。これらの植物成長調節物質は、下に例示されるような一定のサブクラスに分けられ得る。

【0024】

(C-1) 抗オーキシシン、例えば(C-1.1)クロフィブリン[2-(4-クロロフェノキシ)-2-メチルプロパン酸(methylpropansäure)]および(C-1.2)2,3,5-トリ-ヨード安息香酸など;

(C-2) オーキシシン、例えば(C-2.1)4-CPA(4-クロロフェノキシ酢酸)、(C-2.2)2,4-D(2,4-ジクロロフェノキシ酢酸)、(C-2.3)2,4-DB[4-(2,4-ジクロロフェノキシ)ブタン酸]、(C-2.4)2,4-DEP{tris[2-(2,4-ジクロロフェノキシ)エチル]ホスファイト}、(C-2.5)ジクロロプロップ、(C-2.6)フェノプロップ、(C-2.7)IAA(-インドール酢酸)、(C-2.8)IBA(4-インドール-3-イルブタン酸)、(C-2.9)ナフタリンアセトアミド、(C-2.10)-ナフタリン酢酸、(C-2.11)1-ナフトール、(C-2.12)ナフトキシ酢酸、(C-2.13)カリウムナフテネート、(C-2.14)ナトリウムナフテネート、(C-2.15)2,4,5-T[(2,4,5-トリクロロフェノキシ)酢酸]など;

(C-3) サイトカイニン、例えば(C-3.1)2iP[N-(3-メチルブタ-2-エニル)-1H-プリン-6-アミン]、(C-3.2)ベンジルアデニン、(C-3.3)カイネチン、(C-3.3)ゼアチンなど;

(C-4) 落葉剤、例えば(C-4.1)カルシウムシアナミド、(C-4.2)ジメチピン、(C-4.3)エンドタール、(C-4.4)エテホン、(C-4.5)メルホス、(C-4.6)メトクスロン、(C-4.7)ペンタクロロフェノール、(C-4.8

10

20

30

40

50

)チジアズロン、(C-4.9)トリブホスなど；
 (C-5)エチレン阻害剤、例えば(C-5.1)アビグリシン、(C-5.2)アビグリシン塩酸塩、(C-5.3)1-メチルシクロプロペンなど；
 (C-6)エチレン生成剤、例えば(C-6.1)ACC(1-アミノシクロプロパンカルボン酸)、(C-6.2)エタセラシル、(C-6.3)エテホン、(C-6.4)グリオキシムなど；
 (C-7)ジベレリン、例えばジベレリンA1(C-7.1)、A4(C-7.2)、A7(C-7.3)、(C-7.4)ジベレリン酸(=ジベレリンA3)など；
 (C-8)成長阻害剤、例えば(C-8.1)アブシジン酸、(C-8.2)アンシミドール、(C-8.3)ブトラリン、(C-8.4)カルバリル、(C-8.5)クロルホニウムまたは(C-8.5A)そのクロリド、(C-8.6)クロルプロファム、(C-8.7)ジケグラック、(C-8.8)ジケグラック-ナトリウム、(C-8.9)フルメトラリン、(C-8.10)フルオリダミド、(C-8.11)ホサミン、(C-8.12)グリホシン、(C-8.13)イソピリモル、(C-8.14)ジャスモン酸、(C-8.15)マレイン酸ヒドラジドまたは(C-8.15A)そのカリウム塩、(C-8.16)メピコートまたは(C-8.16A)そのクロリド、(C-8.17)ピプロクタニルまたは(C-8.17A)そのブロミド、(C-8.18)プロヒドロジャスモン、(C-8.19)プロファム、(C-8.20)2,3,5-トリ-ヨード安息香酸など；
 (C-9)モルファクチン、例えば(C-9.1)クロルフルレン、(C-9.2)クロルフルレノール、(C-9.3)クロルフルレノール-メチル、(C-9.4)ジクロロフルレノール、(C-9.5)フルレノールなど；
 (C-10)成長遅延剤/調節剤、例えば(C-10.1)クロルメコート、(C-10.2)クロルメコート-クロリド、(C-10.3)ダミノジド、(C-10.4)フルルプリミドール、(C-10.5)メフルイジド、(C-10.6)メフルイジド-ジオラミン、(C-10.7)パクロブトラゾール、(C-10.8)シプロコナゾール、(C-10.9)テトシクラシス、(C-10.10)ウニコナゾール、(C-10.11)ウニコナゾール-Pなど；
 (C-11)成長刺激剤、例えば(C-11.1)ブラシノリド、(C-11.2)ホルクロルフェヌロン、(C-11.3)ヒメキサゾール、(C-11.4)2-アミノ-6-オキシブリン誘導体、(C-11.5)インドリノン誘導体、(C-11.6)3,4-二置換マレイミド誘導体および(C-11.7)アゼピノン誘導体など；
 (C-12)分類されないPGR、例えば(C-12.1)ベンゾフルオル、(C-12.2)ブミナホス、(C-12.3)カルボン、(C-12.4)シオブチド、(C-12.5)クロフェンセット、(C-12.6)クロフェンス(clofence)-カリウム、(C-12.7)クロキシホナック、(C-12.8)クロキシホナック-ナトリウム、(C-12.9)シクラニリド、(C-12.10)シクロヘキシミド、(C-12.11)エポコレオン、(C-12.12)エチクロゼート、(C-12.13)エチレン、(C-12.14)フェンリダゾン、(C-12.15)ヘプトパルギル、(C-12.16)ホロスルフ、(C-12.17)イナベンフィド、(C-12.18)カレタザン、(C-12.19)ブレイアルセナト(bleiarsenat)、(C-12.20)メタスルホカルブ、(C-12.21)プロヘキサジオン、(C-12.22)プロヘキサジオン-カルシウム、(C-12.23)ピダノン、(C-12.24)シントフェン、(C-12.25)トリアペンテノール、(C-12.26)トリネキサパックおよび(C-12.27)トリネキサパック-エチルなど；
 (C-13)ならびに他のPGR、例えば(C-13.1)2,6-ジイソプロピルナフタリン、(C-13.2)クロプロップ、(C-13.3)エチル1-ナフチルアセテート、(C-13.4)イソプロチオラン、(C-13.5)MC PB-エチル[エチル4-(4-クロロ-o-トリルオキシ)ブタノエート]、(C-13.6)N-アセチルチアゾリジン-4-カルボン酸、(C-13.7)n-デカノール、(C-13.8)

10

20

30

40

50

ペラルゴン酸、(C - 13 . 9) N - フェニルフタルイミド酸 (p h e n y l p h t h a l i m i c a c i d)、(C - 13 . 10) テクナゼン、(C - 13 . 11) トリアコンタノール、(C - 13 . 12) 2, 3 - ジヒドロ - 5, 6 - ジフェニル - 1, 4 - オキサチン、(C - 13 . 13) 2 - シアノ - 3 - (2, 4 - ジクロロフェニル) アクリル酸、(C - 13 . 14) 2 - ヒドラジノエタノール、(C - 13 . 15) アロラック、(C - 13 . 16) アミドクロル、(C - 13 . 17) BTS 44584 [ジメチル(4 - ピペリジノカルボニルオキシ - 2, 5 - キシリル) スルホニウム - トルエン - 4 - スルホネート]、(C - 13 . 18) クロランベン、(C - 13 . 19) クロルフルレン、(C - 13 . 20) クロルフルレン - メチル、(C - 13 . 21) ジカンバ - メチル、(C - 13 . 22) ジクロルフルレノール、(C - 13 . 23) ジクロルフルレノール - メチル、(C - 13 . 24) ジメキサノ、(C - 13 . 25) エタセラシル、(C - 13 . 26) ヘキサフルオロアセトン三水和物、(C - 13 . 27) N - (2 - エチル - 2H - ピラゾール - 3 - イル) - N' - フェニルウレア、(C - 13 . 28) N - m - トリルフタルアミド酸、(C - 13 . 29) N - ピロリジノスクシンアミド酸、(C - 13 . 30) プロピル 3 - t e r t - ブチルフェノキシアセテート、(C - 13 . 31) ピダノン、(C - 13 . 32) ナトリウム (Z) - 3 - クロロアクリレートなど。

【0025】

好ましくは、クロルメコート、クロルメコート - クロリド、シクラニリド、ジメチピン、エテホン、フルメトラリン、フルルプリミドール、イナベンフィド、メピコート、メピコート - クロリド、1 - メチルシクロプロペン、パクロブトラゾール、プロヘキサジオン - カルシウム、プロヒドロジャスモン、トリブホス、チジアズロン、トリネキサパック、トリネキサパック - エチルまたはウニコナゾールが、式 (I) の N - シクロプロピル - N - [置換 - ベンジル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドまたはチオカルボキサミド誘導体の混合相手として用いられる。

【0026】

上述の植物成長調節物質の全ては公知である [The Pesticide Manual, 14th Edition (2006) およびインターネットホームページ <http://www.alanwood.net/pesticides/index.html> の下の Compendium of Pesticide Common Names を参照されたい]。

【0027】

グループ (D)

グループ (D) の毒性緩和剤は、一般に、作物植物適合性を改良する化合物であって、(D - 1) 4 - ジクロロアセチル - 1 - オキサ - 4 - アザスピロ [4.5] デカン (AD - 67)、(D - 2) ジシクロノン、(D - 3) ベノキサコール、(D - 4) クロキントセット - メキシル (EP - A - 0086750、EP - A - 0094349、EP - A - 0191736、EP - A - 0492366 中の類縁の化合物も参照されたい)、(D - 5) クミルロン、(D - 6) シオメトリニル、(D - 7) 2, 4 - ジクロロフェノキシ酢酸 (2, 4 - D)、(D - 8) 4 - (2, 4 - ジクロロフェノキシ) 酪酸 (2, 4 - DB)、(D - 9) ダイムロン (daimuron) (ダイムロン (dymron))、(D - 10) ジカンバ、(D - 11) ジメピレレート、(D - 12) 2, 2 - ジクロロ - N - (2 - オキソ - 2 - (2 - プロペニルアミノ) エチル) - N - (2 - プロペニル) アセトアミド (DKA - 24)、(D - 13) ジクロルミド、(D - 14) フェンクロリム、(D - 15) フェンクロラゾール - エチル (EP - A - 0174562 および EP - A - 346620 中の類縁の化合物も参照されたい)、(D - 16) フラゾール、(D - 17) フルキソフェニム、(D - 18) フリラゾール、(D - 19) イソキサジフェン - エチル (WO - A - 95/07897 中の類縁の化合物も参照されたい)、(D - 20) ラクチジクロル (lactidichlor)、(D - 21) (4 - クロロ - o - トリルオキシ) 酢酸 (MCPA)、(D - 22) メコプロップ、(D - 23) メフェンピル - ジエチ

10

20

30

40

50

ル (WO - A - 91 / 07874 中の類縁の化合物も参照されたい)、(D - 24) 2 - ジクロロメチル - 2 - メチル - 1, 3 - ジオキソラン (MG - 191)、(D - 25) 2 - プロペニル - 1 - オキサ - 4 - アザスピロ [4.5] デカン 4 - カルボジチオエート (MG - 838)、(D - 26) 1, 8 - ナフタール酸無水物、(D - 27) オキサベトリニル、(D - 28) 2, 2 - ジクロロ - N - (1, 3 - ジオキソラン - 2 - イルメチル) - N - (2 - プロペニル) アセトアミド (PPG - 1292)、(D - 29) 3 - ジクロロアセチル - 2, 2 - ジメチルオキサゾリジン (R - 28725)、(D - 30) 3 - ジクロロアセチル - 2, 2, 5 - トリメチルオキサゾリジン (R - 29148)、(D - 31) 4 - (4 - クロロ - o - トリル) 酪酸、(D - 32) 4 - (4 - クロロフェノキシ) 酪酸、(D - 33) ジフェニルメトキシ酢酸、(D - 34) メチル ジフェニルメトキシアセテート、(D - 35) エチル ジフェニルメトキシアセテート、(D - 36) メチル 1 - (2 - クロロフェニル) - 5 - フェニル - 1H - ピラゾール - 3 - カルボキシレート、(D - 37) エチル 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - メチル - 1H - ピラゾール - 3 - カルボキシレート、(D - 38) エチル 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - イソプロピル - 1H - ピラゾール - 3 - カルボキシレート、(D - 39) エチル 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - (1, 1 - ジメチルエチル) - 1H - ピラゾール - 3 - カルボキシレート、(D - 40) エチル 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - フェニル - 1H - ピラゾール - 3 - カルボキシレート (EP - A - 0269806 および EP - A - 0333131 中の類縁の化合物も参照されたい)、(D - 41) エチル 5 - (2, 4 - ジクロロベンジル) - 2 - イソキサゾリン - 3 - カルボキシレート、(D - 42) エチル 5 - フェニル - 2 - イソキサゾリン - 3 - カルボキシレート、(D - 43) エチル 5 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - フェニル - 2 - イソキサゾリン - 3 - カルボキシレート (WO - A - 91 / 08202 中の類縁の化合物も参照されたい)、(D - 44) 1, 3 - ジメチルブタ - 1 - イル 5 - クロロキノリン - 8 - オキシアセテート、(D - 45) 4 - アリルオキシプロパ - 2 - イル 5 - クロロキノリン - 8 - オキシアセテート、(D - 46) 1 - アリルオキシプロパ - 2 - イル 5 - クロロキノリン - 8 - オキシアセテート、(D - 47) メチル 5 - クロロキノキサリン - 8 - オキシアセテート、(D - 48) エチル 5 - クロロキノリン - 8 - オキシアセテート、(D - 49) アリル 5 - クロロキノキサリン - 8 - オキシアセテート、(D - 50) 2 - オキシプロパ - 1 - イル 5 - クロロキノリン - 8 - オキシアセテート、(D - 51) ジエチル 5 - クロロキノリン - 8 - オキシマロネート、(D - 52) ジアリル 5 - クロロキノキサリン - 8 - オキシマロネート、(D - 53) ジエチル 5 - クロロキノリン - 8 - オキシマロネート (EP - A - 0582198 中の類縁の化合物も参照されたい)、(D - 54) 4 - カルボキシクロマン - 4 - イル - 酢酸 (AC - 304415、EP - A - 0613618 を参照されたい)、(D - 55) 4 - クロロフェノキシ酢酸、(D - 56) 3, 3' - ジメチル - 4 - メトキシベンゾフェノン、(D - 57) 1 - ブロモ - 4 - クロロメチルスルホニルベンゼン、(D - 58) 1 - [4 - (N - 2 - メトキシベンゾイルスルファモイル) フェニル] - 3 - メチルウレア (別名 N - (2 - メトキシベンゾイル) - 4 - [(メチルアミノカルボニル) アミノ] ベンゼンスルホンアミド)、(D - 59) 1 - [4 - (N - 2 - メトキシベンゾイルスルファモイル) フェニル] - 3, 3 - ジメチルウレア、(D - 60) 1 - [4 - (N - 4, 5 - ジメチルベンゾイルスルファモイル) フェニル] - 3 - メチルウレア、(D - 61) 1 - [4 - (N - ナフチルスルファモイル) フェニル] - 3, 3 - ジメチルウレア、(D - 62) N - {[4 - (シクロプロピルカルバモイル) フェニル] スルホニル} - 2 - メトキシベンズアミド (シプロスルファミド)、(D - 63) N - {[4 - (シクロプロピルカルバモイル) フェニル] スルホニル} - 2 - メトキシ - 5 - メチルベンズアミドよりなる群から選択される。

【0028】

グループ (D) の好ましい毒性緩和剤は、(D - 4) クロキントセット - メキシル、(D - 5) クミルロン、(D - 9) ダイムロン (dymron)、(D - 11) ジメピレート、(D - 14) フェンクロリム、(D - 15) フェンクロラゾール - エチル、(D -

10

20

30

40

50

18) フリラゾール、(D-19) イソキサジフェン - エチル、(D-23) メフェンピル - ジエチル、(D-62) N - { [4 - (シクロプロピルカルバモイル) フェニル] スルホニル } - 2 - メトキシベンズアミド (シプロスルファミド) および (D-63) N - { [4 - (シクロプロピルカルバモイル) フェニル] スルホニル } - 2 - メトキシ - 5 - メチルベンズアミドである。

【0029】

さらに、グループ(D)中で言及されている毒性緩和剤は、例えば、C. D. S. Tomlin (Ed.), The Pesticide Manual, 13th Edition, British Crop Protection Council, Farnham, 2003 (またはその後の版) 中に記載されている。

10

【0030】

好ましい実施形態において、本発明は、式(I)の化合物としての化合物(A1)、(A2)、(A3)、(A4)、(A5)、(A6)、(A7)、(A8)、(A9)、(A10)、(A11)、(A12)、(A13)、(A14)、(A15)、(A16)、(A17)、(A18)、(A19)または(A20)と、1の構成成分(B)、(C)または(D)とを含む混合物に関する。

【0031】

とりわけ、本発明は、式(I)の化合物としての化合物(A1)、(A2)、(A3)、(A4)、(A5)、(A6)、(A7)、(A8)、(A9)、(A10)、(A11)、(A12)、(A13)、(A14)、(A15)、(A16)、(A17)、(A18)、(A19)または(A20)、ならびに(B-A.1.1.1)、(B-A.1.1.2)、(B-A.1.1.3)、(B-A.1.1.4)、(B-A.1.1.5)、(B-A.1.1.6)、(B-A.1.1.7)、(B-A.1.1.8)、(B-A.1.1.9)、(B-A.1.1.10)、(B-A.1.1.11)、(B-A.1.1.12)、(B-A.1.1.13)、(B-A.1.1.14)、(B-A.1.1.15)、(B-A.1.1.16)、(B-A.1.1.17)、(B-A.1.1.18)、(B-A.1.1.19)、(B-A.1.1.20)、(B-A.1.1.21)、(B-A.1.1.22)、(B-A.1.1.23)、(B-A.1.1.24)、(B-A.1.1.25)、(B-A.1.1.26)、(B-A.1.1.27)、(B-A.1.1.28)、(B-A.1.1.29)、(B-A.1.1.30)、(B-A.1.1.31)、(B-A.1.1.32)、(B-A.1.1.33)、(B-A.1.1.34)、(B-A.1.1.35)、(B-A.1.1.36)、(B-A.1.1.37)、(B-A.1.1.38)、(B-A.1.1.39)、(B-A.1.1.40)、(B-A.1.1.41)、(B-A.1.1.42)、(B-A.1.1.43)、(B-A.1.1.44)、(B-A.1.1.45)、(B-A.1.1.46)、(B-A.1.1.47)、(B-A.1.2.1)、(B-A.1.2.2)、(B-A.1.2.3)、(B-A.1.2.4)、(B-A.1.2.5)、(B-A.1.2.6)、(B-A.1.2.7)、(B-A.1.2.8)、(B-A.1.2.9)、(B-A.1.2.10)、(B-A.1.3.1)、(B-A.2.1.1)、(B-A.2.1.2)、(B-A.2.1.3)、(B-A.2.1.4)、(B-A.2.1.5)、(B-A.2.1.6)、(B-A.2.1.7)、(B-A.2.1.8)、(B-A.2.1.9)、(B-A.2.1.10)、(B-A.2.1.11)、(B-A.2.1.11a)、(B-A.2.1.11b)、(B-A.2.1.12)、(B-A.2.1.13)、(B-A.2.1.14)、(B-A.2.1.14a)、(B-A.2.1.14b)、(B-A.2.1.15)、(B-A.2.1.15a)、(B-A.2.1.15b)、(B-A.2.1.16)、(B-A.2.1.17)、(B-A.2.1.18)、(B-A.2.1.19)、(B-A.2.1.20)、(B-A.2.1.21)、(B-A.2.1.22)、(B-A.2.1.23)、(B-A.2.1.24)、(B-A.2.1.25)、(B-A.2.1.26)、(B-A.2.1.27)、(B-A.2.1.28)、(B-A

20

30

40

50

. 2 . 1 . 2 9)、(B - A . 2 . 1 . 2 9 a)、(B - A . 2 . 1 . 2 9 b)、(B -
 A . 2 . 1 . 2 9 c)、(B - A . 2 . 1 . 3 0)、(B - A . 2 . 1 . 3 1)、(B -
 A . 2 . 1 . 3 2)、(B - A . 2 . 1 . 3 3)、(B - A . 2 . 1 . 3 3 a)、(B -
 A . 2 . 1 . 3 3 b)、(B - A . 2 . 1 . 3 4)、(B - A . 2 . 1 . 3 5)、(B -
 A . 2 . 1 . 3 6)、(B - A . 2 . 1 . 3 7)、(B - A . 2 . 1 . 3 7 a)、(B -
 A . 2 . 1 . 3 7 b)、(B - A . 2 . 1 . 3 8)、(B - A . 2 . 1 . 3 9)、(B -
 A . 2 . 1 . 4 0)、(B - A . 2 . 1 . 4 1)、(B - A . 2 . 1 . 4 2)、(B - A
 . 2 . 1 . 4 3)、(B - A . 2 . 1 . 4 4)、(B - A . 2 . 1 . 4 5)、(B - A .
 2 . 1 . 4 6)、(B - A . 2 . 1 . 4 7)、(B - A . 2 . 1 . 4 8)、(B - A . 2
 . 1 . 4 9)、(B - A . 2 . 1 . 5 0)、(B - A . 2 . 1 . 5 1)、(B - A . 2 .
 1 . 5 2)、(B - A . 2 . 1 . 5 3)、(B - A . 2 . 1 . 5 4)、(B - A . 2 . 1
 . 5 5)、(B - A . 2 . 1 . 5 6)、(B - A . 2 . 1 . 5 6 a)、(B - A . 2 . 1
 . 5 6 b)、(B - A . 2 . 1 . 5 7)、(B - A . 2 . 1 . 5 7 a)、(B - A . 2 .
 1 . 5 7 b)、(B - A . 2 . 1 . 5 8)、(B - A . 2 . 1 . 5 9)、(B - A . 2 .
 1 . 6 0)、(B - A . 2 . 1 . 6 1)、(B - A . 2 . 1 . 6 2)、(B - A . 2 . 1
 . 6 2 a)、(B - A . 2 . 1 . 6 2 b)、(B - A . 2 . 1 . 6 3)、(B - A . 2 .
 1 . 6 4)、(B - A . 2 . 1 . 6 5)、(B - A . 2 . 1 . 6 6)、(B - A . 2 . 1
 . 6 7)、(B - A . 2 . 1 . 6 8)、(B - A . 2 . 1 . 6 8 a)、(B - A . 2 . 1
 . 6 8 b)、(B - A . 2 . 1 . 6 9)、(B - A . 2 . 2 . 1)、(B - A . 2 . 2 .
 1 a)、(B - A . 2 . 1 . 1 b)、(B - A . 2 . 1 . 1 c)、(B - A . 2 . 2 . 2
)、(B - A . 2 . 3 . 1)、(B - A . 2 . 3 . 2)、(B - A . 2 . 3 . 1 a)、(B -
 A . 2 . 3 . 1 b)、(B - A . 2 . 3 . 1 c)、(B - A . 3 . 1 . 1)、(B -
 A . 3 . 1 . 1 a)、(B - A . 3 . 1 . 2)、(B - A . 3 . 1 . 3)、(B - A . 3
 . 1 . 4)、(B - A . 3 . 1 . 5)、(B - A . 3 . 1 . 6)、(B - A . 3 . 1 . 7
)、(B - A . 3 . 1 . 8)、(B - A . 3 . 1 . 9)、(B - A . 3 . 1 . 1 0)、(B -
 A . 3 . 1 . 1 1)、(B - A . 3 . 1 . 1 2)、(B - A . 3 . 1 . 1 2 a)、(B -
 A . 3 . 1 . 1 2 b)、(B - A . 3 . 1 . 1 2 c)、(B - A . 3 . 1 . 1 2 d)
 、(B - A . 3 . 1 . 1 2 e)、(B - A . 3 . 1 . 1 2 f)、(B - A . 3 . 1 . 1 2
 g)、(B - A . 3 . 1 . 1 3)、(B - A . 3 . 1 . 1 4)、(B - A . 3 . 1 . 1 5
)、(B - A . 3 . 1 . 1 5 a)、(B - A . 3 . 1 . 1 6)、(B - A . 3 . 1 . 1 7
)、(B - A . 3 . 1 . 1 7 a)、(B - A . 3 . 1 . 1 7 b)、(B - A . 3 . 1 . 1
 7 c)、(B - A . 3 . 1 . 1 7 d)、(B - A . 3 . 1 . 1 7 e)、(B - A . 3 . 1
 . 1 7 f)、(B - A . 3 . 1 . 1 7 g)、(B - A . 3 . 1 . 1 8)、(B - A . 3 .
 1 . 1 9)、(B - A . 3 . 1 . 2 0)、(B - A . 3 . 1 . 2 0 a)、(B - A . 3 .
 1 . 2 0 b)、(B - A . 3 . 1 . 2 0 c)、(B - A . 3 . 1 . 2 1)、(B - A . 3
 . 1 . 2 2)、(B - A . 3 . 1 . 2 3)、(B - A . 3 . 1 . 2 4)、(B - A . 3 .
 1 . 2 5)、(B - A . 3 . 1 . 2 6)、(B - A . 3 . 1 . 2 7)、(B - A . 3 . 1
 . 2 8)、(B - A . 3 . 1 . 2 9)、(B - A . 3 . 1 . 3 0)、+ (B - A . 3 . 1
 . 3 1)、(B - A . 3 . 1 . 3 2)、(B - A . 3 . 2 . 1)、(B - A . 3 . 2 . 2
)、(B - A . 3 . 2 . 3)、(B - A . 3 . 2 . 4)、(B - A . 3 . 2 . 5)、(B
 - A . 3 . 2 . 6)、(B - A . 3 . 2 . 7)、(B - A . 3 . 2 . 8)、(B - A . 3
 . 2 . 9)、(B - A . 3 . 2 . 1 0)、(B - A . 3 . 2 . 1 1)、(B - A . 3 . 2
 . 1 2)、(B - A . 3 . 2 . 1 3)、(B - A . 3 . 2 . 1 4)、(B - A . 3 . 2 .
 1 5)、(B - A . 3 . 2 . 1 6)、(B - A . 3 . 2 . 1 7)、(B - A . 3 . 2 . 1
 8)、(B - A . 3 . 2 . 1 9)、(B - A . 4 . 1 . 1)、(B - A . 4 . 1 . 2)、
 (B - A . 4 . 1 . 3)、(B - A . 4 . 1 . 4)、(B - A . 4 . 1 . 5)、(B - A
 . 4 . 2 . 1)、(B - A . 4 . 2 . 2)、(B - A . 4 . 2 . 3)、(B - A . 4 . 2
 . 4)、(B - A . 4 . 2 . 5)、(B - A . 4 . 2 . 6)、(B - A . 4 . 2 . 7)、
 (B - A . 4 . 2 . 8)、(B - A . 4 . 2 . 9)、(B - A . 4 . 2 . 1 0)、(B -
 A . 4 . 2 . 1 1)、(B - A . 4 . 2 . 1 2)、(B - A . 4 . 2 . 1 3)、(B - A

10

20

30

40

50

. 4 . 2 . 1 4)、(B - A . 4 . 2 . 1 5)、(B - A . 4 . 2 . 1 6)、(B - A .
 4 . 2 . 1 7)、(B - A . 4 . 3 . 1)、(B - A . 4 . 3 . 2)、(B - A . 4 . 3
 . 3)、(B - A . 4 . 4 . 1)、(B - A . 4 . 4 . 2)、(B - A . 4 . 4 . 3)、
 (B - A . 4 . 4 . 4)、(B - A . 4 . 4 . 5)、(B - A . 4 . 4 . 6)、(B - A
 . 4 . 4 . 7)、(B - A . 4 . 4 . 8)、(B - A . 4 . 4 . 9)、(B - A . 4 . 4
 . 1 0)、(B - A . 4 . 4 . 1 1)、(B - A . 4 . 4 . 1 2)、(B - A . 4 . 4 .
 1 3)、(B - A . 4 . 4 . 1 4)、(B - A . 4 . 4 . 1 5)、(B - A . 4 . 4 . 1
 6)、(B - A . 4 . 4 . 1 7)、(B - A . 4 . 4 . 1 8)、(B - A . 4 . 4 . 1 9
)、(B - A . 4 . 4 . 2 0)、(B - A . 4 . 4 . 2 1)、(B - A . 4 . 4 . 2 2)
 、(B - A . 4 . 4 . 2 2 a)、(B - A . 5 . 1 . 1)、(B - A . 5 . 1 . 2)、(10
 B - A . 5 . 1 . 3)、(B - A . 5 . 1 . 4)、(B - A . 5 . 1 . 5)、(B - A .
 5 . 1 . 6)、(B - A . 5 . 1 . 7)、(B - A . 5 . 1 . 8)、(B - A . 5 . 1 .
 9)、(B - A . 5 . 1 . 1 0)、(B - A . 5 . 1 . 1 1)、(B - A . 5 . 1 . 1 2
)、(B - A . 5 . 1 . 1 3)、(B - A . 5 . 1 . 1 4)、(B - A . 5 . 1 . 1 5)
 、(B - A . 5 . 1 . 1 6)、(B - A . 5 . 1 . 1 7)、(B - A . 5 . 1 . 1 8)、
 (B - A . 5 . 1 . 1 9)、(B - A . 5 . 1 . 2 0)、(B - A . 5 . 1 . 2 1)、(B
 - A . 5 . 1 . 2 2)、(B - A . 5 . 1 . 2 3)、(B - A . 5 . 1 . 2 4)、(B
 - A . 5 . 1 . 2 5)、(B - A . 5 . 1 . 2 6)、(B - A . 5 . 1 . 2 7)、(B -
 A . 5 . 1 . 2 8)、(B - A . 5 . 1 . 2 9)、(B - A . 5 . 1 . 3 0)、(B - A
 . 5 . 1 . 3 1)、+ (B - A . 5 . 1 . 3 2)、(B - A . 5 . 1 . 3 3)、(B - A 20
 . 5 . 1 . 3 4)、(B - A . 5 . 1 . 3 5)、(B - A . 5 . 1 . 3 6)、(B - A .
 5 . 1 . 3 7)、(B - A . 5 . 1 . 3 8)、(B - A . 5 . 1 . 3 9)、(B - A . 5
 . 1 . 4 0)、(B - A . 5 . 1 . 4 1)、(B - A . 5 . 1 . 4 2)、(B - A . 5 .
 1 . 4 3)、(B - A . 5 . 1 . 4 4)、(B - A . 5 . 1 . 4 5)、(B - A . 5 . 1
 . 4 6)、(B - A . 5 . 1 . 4 7)、(B - A . 5 . 1 . 4 8)、(B - A . 5 . 1 .
 4 9)、(B - A . 5 . 1 . 5 0)、(B - A . 6 . 1)、(B - A . 6 . 2)、(B -
 A . 6 . 3)、(B - A . 6 . 4)、(B - A . 6 . 5)、(B - A . 6 . 6)、(B -
 A . 6 . 7)、(B - A . 6 . 8)、(B - A . 6 . 9)、(B - A . 6 . 1 0)、(B
 - A . 6 . 1 1)、(B - A . 6 . 1 2)、(B - A . 6 . 1 3)、(B - A . 6 . 1 4
)、(B - A . 6 . 1 5)、(B - A . 6 . 1 6)、(B - A . 6 . 1 7)、(B - A . 30
 6 . 1 8)、(B - A . 6 . 1 9)、(B - A . 6 . 2 0)、(B - A . 6 . 2 1)、(B
 - A . 6 . 2 2)、(B - A . 7 . 1)、(B - A . 7 . 2)、(B - A . 7 . 3)、
 (B - A . 7 . 4)、(B - A . 7 . 5)、(B - A . 7 . 6)、(B - A . 7 . 7)、
 (B - A . 7 . 8)、(B - A . 7 . 9)、(B - A . 7 . 1 0)、(B - A . 7 . 1 1
)、(B - A . 7 . 1 2)、(B - A . 7 . 1 3)、(B - A . 7 . 1 4)、(B - A .
 7 . 1 5)、(B - A . 7 . 1 6)、(B - A . 7 . 1 7)、(B - B . 1 . 1)、(B
 - B . 1 . 1 a)、(B - B . 1 . 2)、(B - B . 1 . 2 a)、(B - B . 2 . 1)、
 (B - B . 2 . 2)、(B - B . 2 . 3)、(B - B . 2 . 4)、(B - B . 2 . 5)、
 (B - B . 2 . 6)、(B - B . 2 . 7)、(B - B . 2 . 8)、(B - B . 2 . 9)、
 (B - B . 2 . 1 0)、(B - B . 2 . 1 1)、(B - B . 2 . 1 2)、(B - B . 2 . 40
 1 3)、(B - B . 2 . 1 4)、(B - B . 2 . 1 5)、(B - B . 2 . 1 6)、(B -
 B . 2 . 1 7)、(B - B . 2 . 1 8)、(B - B . 2 . 1 9)、(B - B . 2 . 2 0)
 、(B - B . 2 . 2 1)、(B - B . 2 . 2 2)、(B - B . 2 . 2 3)、(B - B . 2
 . 2 4)、(B - B . 2 . 2 5)、(B - B . 2 . 2 6)、(B - B . 2 . 2 7)、(B
 - B . 3 . 1)、(B - B . 3 . 2)、(B - B . 3 . 3)、(B - B . 4 . 1)、(B
 -
 B . 4 . 2)、(C - 1 . 1)、(C - 1 . 2)、(C - 2 . 1)、(C - 2 . 2)、(C
 - 2 . 3)、(C - 2 . 4)、(C - 2 . 5)、(C - 2 . 6)、(C - 2 . 7)、(C
 - 2 . 8)、(C - 2 . 9)、(C - 2 . 1 0)、(C - 2 . 1 1)、(C - 2 . 1 2
)、(C - 2 . 1 3)、(C - 2 . 1 4)、(C - 2 . 1 5)、(C - 3 . 1)、(C - 50

3 . 2)、(C - 3 . 3)、(C - 3 . 3)、(C - 4 . 1)、(C - 4 . 2)、(C -
 4 . 3)、(C - 4 . 4)、(C - 4 . 5)、(C - 4 . 6)、(C - 4 . 7)、(C -
 4 . 8)、(C - 4 . 9)、(C - 5 . 1)、(C - 5 . 2)、(C - 5 . 3)、(C -
 6 . 1)、(C - 6 . 2)、(C - 6 . 3)、(C - 6 . 4)、(C - 7 . 1)、(C -
 7 . 2)、(C - 7 . 3)、(C - 7 . 4)、(C - 8 . 1)、(C - 8 . 2)、(C -
 8 . 3)、(C - 8 . 4)、(C - 8 . 5)、(C - 8 . 5 A)、(C - 8 . 6)、(C -
 8 . 7)、(C - 8 . 8)、(C - 8 . 9)、(C - 8 . 10)、(C - 8 . 11)、
 (C - 8 . 12)、(C - 8 . 13)、(C - 8 . 14)、(C - 8 . 15)、(C - 8
 . 15 A)、(C - 8 . 16)、(C - 8 . 16 A)、(C - 8 . 17)、(C - 8 . 1
 7 A)、(C - 8 . 18)、(C - 8 . 19)、(C - 8 . 20)、(C - 9 . 1)、(10
 C - 9 . 2)、(C - 9 . 3)、(C - 9 . 4)、(C - 9 . 5)、(C - 10 . 1)、
 (C - 10 . 2)、(C - 10 . 3)、(C - 10 . 4)、(C - 10 . 5)、(C - 1
 0 . 6)、(C - 10 . 7)、(C - 10 . 8)、(C - 10 . 9)、(C - 10 . 10
)、(C - 10 . 11)、(C - 11 . 1)、(C - 11 . 2)、(C - 11 . 3)、(C - 11 . 4)、
 (C - 11 . 5)、(C - 11 . 6)、(C - 11 . 7)、(C - 12
 . 1)、(C - 12 . 2)、(C - 12 . 3)、(C - 12 . 4)、(C - 12 . 5)、
 (C - 12 . 6)、(C - 12 . 7)、(C - 12 . 8)、(C - 12 . 9)、(C - 1
 2 . 10)、(C - 12 . 11)、(C - 12 . 12)、(C - 12 . 13)、(C - 1
 2 . 14)、(C - 12 . 15)、(C - 12 . 16)、(C - 12 . 17)、(C - 1
 2 . 18)、(C - 12 . 19)、(C - 12 . 20)、(C - 12 . 21)、(C - 1 20
 2 . 22)、(C - 12 . 23)、(C - 12 . 24)、(C - 12 . 25)、(C - 1
 2 . 26)、(C - 12 . 27)、(C - 13 . 1)、(C - 13 . 2)、(C - 13 .
 3)、(C - 13 . 4)、(C - 13 . 5)、(C - 13 . 6)、(C - 13 . 7)、(C -
 13 . 8)、(C - 13 . 9)、(C - 13 . 10)、(C - 13 . 11)、(C -
 13 . 12)、(C - 13 . 13)、(C - 13 . 14)、(C - 13 . 15)、(C -
 13 . 16)、(C - 13 . 17)、(C - 13 . 18)、(C - 13 . 19)、(C -
 13 . 20)、(C - 13 . 21)、(C - 13 . 22)、(C - 13 . 23)、(C -
 13 . 24)、(C - 13 . 25)、(C - 13 . 26)、(C - 13 . 27)、(C -
 13 . 28)、(C - 13 . 29)、(C - 13 . 30)、(C - 13 . 31)、(C -
 13 . 32)、(D - 1)、(D - 2)、(D - 3)、(D - 4)、(D - 5)、(D - 30
 6)、(D - 7)、(D - 8)、(D - 9)、(D - 10)、(D - 11)、(D - 12
)、(D - 13)、(D - 14)、(D - 15)、(D - 16)、(D - 17)、(D -
 18)、(D - 19)、(D - 20)、(D - 21)、(D - 22)、(D - 23)、(D -
 24)、(D - 25)、(D - 26)、(D - 27)、(D - 28)、(D - 29)
 、(D - 30)、(D - 31)、(D - 32)、(D - 33)、(D - 34)、(D - 3
 5)、(D - 36)、(D - 37)、(D - 38)、(D - 39)、(D - 40)、(D
 - 41)、(D - 42)、(D - 43)、(D - 44)、(D - 45)、(D - 46)、
 (D - 47)、(D - 48)、(D - 49)、(D - 50)、(D - 51)、(D - 52
)、(D - 53)、(D - 54)、(D - 55)、(D - 56)、(D - 57)、(D -
 58)、(D - 59)、(D - 60)、(D - 61)、(D - 62)および(D - 63) 40
 よりなるリスト L 1 の中から選択される少なくとも 1 の化合物を含む混合物に関する。

【 0 0 3 2 】

なおよりとりわけ、本発明は、式 (I) の化合物としての化合物 (A 2)、(A 5)、
 (A 7) または (A 1 2)、とりわけ (A 5) と、および本明細書中で記載されているリ
 スト L 1 の中から選択される少なくとも 1 の化合物とを含む混合物に関する。

【 0 0 3 3 】

活性化合物が本発明による活性化合物の組み合わせ中にある一定の重量比で存在する場
 合、相乗効果はとりわけ著しい。しかしながら、活性化合物の組み合わせ中の活性化合物
 の重量比は、比較的広い範囲内で変えることができる。

【 0 0 3 4 】

本発明による組み合わせ中で、化合物(A)および(B)は、100:1から1:100の範囲内のA:Bの相乗的に有効な重量比で、好ましくは50:1から1:50の重量比で、より好ましくは20:1から1:20の重量比で、なおより好ましくは10:1から1:10の重量比で存在する。本発明に従って用いることができるA:Bのさらなる比は、好ましさが増す順に:95:1から1:95、90:1から1:90、85:1から1:85、80:1から1:80、75:1から1:75、70:1から1:70、65:1から1:65、60:1から1:60、55:1から1:55、45:1から1:45、40:1から1:40、35:1から1:35、30:1から1:30、25:1から1:25、15:1から1:15、10:1から1:10、5:1から1:5、4:1から1:4、3:1から1:3、2:1から1:2である。

10

【0035】

本発明の方法において、本発明による活性化合物の組み合わせは、葉に対して、0.1から10000g/haまでの用量で施用され、種子に対して、種子100kgあたり2から200gまでの用量で施用される。

【0036】

化合物(A)、(B)、(C)または(D)が互変異性形態で存在することができる場合、かかる化合物は、本明細書の前後において、各々の場合で具体的に言及されていなくとも、適用可能な場合に対応する互変異性形態を包含するものとも理解される。

【0037】

少なくとも1の塩基性中心を持つ化合物(A)、(B)、(C)または(D)は、例えば、酸付加塩、例として強無機酸、例えば鉱酸、例として過塩素酸、硫酸、硝酸、亜硝酸、リン酸もしくはハロゲン化水素酸などとの、強有機カルボン酸、例えば置換されていない、置換されている、例としてハロ置換されている $C_1 - C_4$ アルカンカルボン酸、例として酢酸、飽和もしくは不飽和のジカルボン酸、例としてシュウ酸、マロン酸、コハク酸、マレイン酸、フマル酸およびフタル酸、ヒドロキシカルボン酸、例としてアスコルビン酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸およびクエン酸もしくは安息香酸などとの、または有機スルホン酸、例えば置換されていないもしくは置換されている、例としてハロ置換されている $C_1 - C_4$ アルカン-スルホン酸もしくはアリール-スルホン酸、例としてメタン-スルホン酸もしくはp-トルエン-スルホン酸などとの酸付加塩を形成する能力がある。少なくとも1の酸性基を持つ化合物(A)、(B)、(C)または(D)は、例えば、塩基との塩、例として金属塩、例えばアルカリ金属もしくはアルカリ土類金属塩、例としてナトリウム、カリウムもしくはマグネシウム塩など、またはアンモニアもしくは有機アミンとの塩、例えばモルフォリン、ピペリジン、ピロリジン、モノ-、ジ-もしくはトリ-低級アルキルアミン、例としてエチル-、ジエチル-、トリエチル-もしくはジメチル-プロピル-アミン、もしくはモノ-、ジ-もしくはトリ-ヒドロキシ-低級アルキルアミン、例としてモノ-、ジ-もしくはトリ-エタノールアミンなどとの塩を形成する能力がある。加えて、対応する分子内塩を形成してもよい。本発明との関連で、好ましいのは農薬的に有利な塩である。遊離形態の化合物(A)、(B)、(C)または(D)とそれらの塩形態との間の密接な関係を考えると、本明細書の前後において、遊離化合物(A)、(B)、(C)もしくは(D)またはそれらの塩へのあらゆる参照は、適切かつ好都合な場合、それぞれ対応する塩または遊離化合物(A)、(B)、(C)もしくは(D)をも包含するものとして理解されるべきである。同じことが化合物(A)、(B)、(C)もしくは(D)の互変異性体およびそれらの塩にも当てはまる。

20

30

40

【0038】

本発明によると、表現「組み合わせ」は、化合物(A)ならびに化合物(B)、(C)および/または(D)の様々な組み合わせを表し、例えば単一の「レディーミックス(ready-mix)」形態、単一活性化合物の別々の製剤から構成される組み合わせ噴霧混合物、例えば「タンクミックス(tank-mix)」など、および逐次的に、すなわち合理的な短期間、例えば数時間または数日などの間隔で順々に施用する場合の単一活性成分の組み合わせ使用を表す。好ましくは、化合物(A)および化合物(B)、(C)ま

50

たは(D)を施用する順番は、本発明を機能させるのに必須ではない。好ましくは、化合物(A)ならびに化合物(B)、(C)および/または(D)の「組み合わせ」は、化合物(A)ならびに化合物(B)、(C)および/または(D)を含む組成物である。

【0039】

本発明は、さらには、本発明による活性化合物の組み合わせを含む、望ましくない微生物を駆除/防除するための組成物に関する。好ましくは、組成物は、農業的に好適な助剤、溶媒、担体、界面活性剤または増量剤を含む殺真菌性組成物である。

【0040】

さらには、本発明は、本発明による活性化合物の組み合わせが植物病原性真菌および/またはそれらの生息場所に施用されることを特徴とする、望ましくない微生物を駆除する方法に関する。

10

【0041】

本発明によると、担体は、より良好な施用性のために、とりわけ植物または植物部分または種子への施用のために活性化合物と混合または組み合わせられる、天然または合成の、有機または無機の物質を意味すると理解されるものである。担体は、固体であっても液体であってもよく、一般に不活性であり、農業における使用に適しているべきである。

【0042】

好適な固体または液体の担体は：例えばアンモニウム塩および天然の粉碎鉱石、例えばカオリン、粘土、タルク、白亜、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイトまたはケイソウ土など、および粉碎された合成鉱石、例えば微細シリカ、アルミナなど、および天然または合成のケイ酸塩、樹脂、蠟、固形肥料、水、アルコール、特にブタノール、有機溶媒、鉱油および植物油、ならびにまたそれらの誘導体である。かかる担体の混合物を用いることもまた可能である。粒剤に適している固体担体は：例えば破碎して分粒された天然鉱石、例えば方解石、大理石、軽石、セピオライト、ドロマイトなど、ならびにまた無機および有機粗粉の合成顆粒、ならびにまた有機材料の顆粒、例えばおがくず、ココナツ殻、トウモロコシ穂軸およびタバコ葉柄などである。

20

【0043】

好適な液化ガスの増量剤または担体は、外界温度、大気圧下で気体である液体であり、例えばエアロゾル噴霧剤、例えばブタン、プロパン、窒素およびCO₂などである。

【0044】

30

粘着付与剤、例えば、カルボキシメチルセルロースなど、ならびに粉末、顆粒およびラテックス形態の天然および合成のポリマー、例えばアラビアゴム、ポリビニルアルコール、ポリビニルアセテートなど、あるいは天然のリン脂質、例えばセファリンおよびレシチンなど、ならびに合成のリン脂質を製剤中で用いることができる。他の可能な添加剤は、鉱油および植物油および蠟であり、これらは改質したものであってもよい。

【0045】

用いられる増量剤が水である場合、例えば、有機溶媒を助剤溶媒として用いることもまた可能である。好適な液体溶媒は、本質的に：芳香族化合物、例えばキシレン、トルエンまたはアルキルナフタレンなど、塩素化芳香族化合物または塩素化脂肪族炭化水素、例えばクロロベンゼン、クロロエチレンまたはメチレンクロリドなど、脂肪族炭化水素、例えばシクロヘキサンまたはパラフィンなど、例えば鉱油留分、鉱油および植物油、アルコール、例えばブタノールまたはグリコールなど、ならびにそれらのエーテルおよびエステル、ケトン、例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサノンなど、強極性溶媒、例えばジメチルホルムアミドおよびジメチルスルホキシドなど、ならびにまた水である。

40

【0046】

本発明による組成物は、付加的なさらなる構成成分、例えば界面活性剤などを含み得る。好適な界面活性剤は、イオン性もしくは非イオン性の性質を持つ乳化剤、分散剤もしくは湿潤剤、またはこれらの界面活性剤の混合物である。これらの例は、ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸またはナフタレンスルホン酸の塩、エ

50

チレンオキシドと脂肪アルコールとの、または脂肪酸との、または脂肪アミンとの重縮合物、置換フェノール（好ましくはアルキルフェノールまたはアリールフェノール）、スルホコハク酸エステル塩、タウリン誘導体（好ましくはアルキルタウレート）、ポリエトキシ化アルコールまたはポリエトキシ化フェノールのリン酸エステル、ポリオール脂肪エステル、ならびにサルフェート、スルホネートおよびホスフェートを含有する化合物の誘導体である。界面活性剤の存在は、活性化化合物のうちの１および／または不活性担体のうちの１が水に不溶性である場合、および施用が水中で行われるときに、必要とされる。界面活性剤の割合は、本発明による組成物のうちの５から４０重量％の間である。

【００４７】

着色剤、例えば無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタン、プルシアンブルーなど、ならびに有機染料、例えばアリザリン染料、アゾ染料および金属フタロシアニン染料など、ならびに微量栄養素、例えば鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩などを用いることが可能である。

【００４８】

適切な場合、他の付加的な構成成分、例えば保護コロイド、バインダー、粘着剤、増粘剤、チキソトロピック物質、浸透剤、安定剤、金属イオン封鎖剤、錯体形成剤も存在し得る。一般的に、活性化化合物は、製剤目的のために慣例的に用いられる任意の固体または液体の添加剤と組み合わせることができる。

【００４９】

一般的に、本発明による組成物は、０．０５から９９重量パーセントの間、０．０１から９８重量パーセントの間、好ましくは０．１から９５重量パーセントの間、とりわけ好ましくは０．５から９０重量パーセントの間の本発明による活性化化合物の組み合わせを含み、大いにとりわけ好ましくは１０から７０重量パーセントの間の本発明による活性化化合物の組み合わせを含む。

【００５０】

本発明による活性化化合物の組み合わせまたは組成物は、そのまま、またはそれらの各物理的および／もしくは化学的性質に応じて、それらの製剤の形態もしくはそれらから調製される使用形態で用いることができ、例えばエアロゾル、カプセル懸濁剤、冷煙霧濃厚剤（cold-fogging concentrate）、温煙霧濃厚剤（warm-fogging concentrate）、カプセル化粒剤、細粒剤、種子処理用のフロアブル剤、使用調製済の溶液、粉剤、乳剤、水中油型エマルジョン、油中水型エマルジョン、マクロ粒剤、微粒剤、油分散性散剤、油混和性フロアブル剤、油混和性液体、フォーム（foam）、ペースト、駆除剤被覆種子、懸濁製剤（suspension concentrate）、サスبوエマルジョン剤、液剤、懸濁剤（suspension）、水和剤、可溶性散剤、可溶性粉剤および可溶性粒剤、水溶性の顆粒剤または錠剤、種子処理用の水溶剤、水和剤、活性化化合物を含浸させた天然物および合成物質、ならびにまたポリマー性物質中および種子用のコーティング材料中のマイクロカプセル化物、ならびにまたＵＬＶ冷煙霧剤および温煙霧剤などの形態で用いることができる。

【００５１】

言及された製剤は、それ自体公知の様式で、例えば活性化化合物または活性化化合物の組み合わせを少なくとも１の添加剤と混合することにより調製することができる。好適な添加剤は、全ての慣例的な製剤助剤、例えば、有機溶媒、増量剤、溶媒または希釈剤、固体担体および充填剤、界面活性剤（例えば補助剤、乳化剤、分散剤、保護コロイド、湿潤剤および粘着付与剤など）、分散剤および／またはバインダーもしくは固定剤、保存剤、染料および顔料、脱泡剤、無機および有機の増粘剤、撥水剤、適切な場合は乾燥剤およびＵＶ安定剤、ジベレリンならびにまた水およびさらなる加工助剤などである。各々の場合における調製対象の製剤タイプに依存して、さらなる加工ステップ、例えば湿式粉碎、乾式粉碎または造粒などが必要とされ得る。

【００５２】

本発明による組成物は、好適な装置を使用して植物または種子に施用することができる

10

20

30

40

50

使用準備済の組成物だけでなく、使用前に水で希釈しなければならない商業的濃縮物も含む。

【0053】

本発明による活性化合物の組み合わせは、(商業的)製剤中で、およびこれらの製剤から調製される使用形態中で、他の(公知の)活性化合物、例えば殺虫剤、誘引剤、滅菌剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺真菌剤、成長調節剤、除草剤、肥料、毒性緩和剤および情報化学物質などとの混合物として存在することができる。

【0054】

活性化合物または組成物を使用した植物および植物部分についての本発明による処理は、直接的にまたはそれらの周辺、生息場所もしくは保存空間に対する作用により、慣例的
10
処理方法を用いて、例えば浸漬、噴霧、微粒化、灌注、蒸散、散粉、霧状散布(fogging)、全面散布(broadcasting)、発泡(foaming)、塗布、展着(spreading-on)、灌水(灌注)、点滴灌漑により、および繁殖材料の場合、とりわけ種子の場合はさらには乾燥種子処理用の散剤、種子処理用の溶液、スラリー処理用の水溶剤として、外殻形成(incrusting)により、1または複数の層を有するコーティングなどにより行われる。さらには、極微量法により活性成分を施用すること、または活性化合物調合剤もしくは活性化合物自体を土壌内に注入することも可能である。

【0055】

本発明は、さらには、種子を処理する方法を含む。本発明は、さらには、先の段落中に
20
記載されている方法のうちの1によって処理された種子に関する。

【0056】

本発明による活性化合物または組成物は、種子の処理に特に適している。有害生物に起因する作物植物への損傷の大部分は、保存中または播種後の種子の感染が、同様に発芽中および発芽後の植物の感染が引き金となる。成長中の植物の根および新芽はとりわけ敏感であり、小さな損傷であっても植物の死をもたらす可能性があることから、この時期はとりわけ決定的である。したがって、適切な組成物を用いることにより種子および発芽中の植物を保護することに大きな関心がある。

【0057】

植物の種子を処理することによる植物病原性真菌の防除は長い間知られたことであり、
30
絶えず続く改良の対象である。しかしながら、種子の処理は、常に満足に解決することができない一連の問題を伴う。それゆえに、植物の播種後もしくは出芽後の作物保護剤の追加施用を不要にする、または追加施用を少なくとも相当に低減させる、種子および発芽中の植物を保護する方法を開発することが望ましい。さらには、使用される活性化合物により植物自身が損傷されることなく、種子および発芽中の植物に植物病原性真菌による攻撃からの最大の保護を提供するように、使用される活性化合物の量を最適化することが望ましい。とりわけ、種子の処理方法はまた、使用される作物保護剤を最小量にしながら種子および発芽中の植物の最適な保護を達成するために、遺伝子導入植物の内因的な殺真菌性を考慮に入れるべきである。

【0058】

したがって、本発明はまた、本発明による組成物を使用して種子を処理することによる
40
、種子および発芽中の植物を植物病原性真菌による攻撃から保護する方法にとりわけ関する。本発明はまた、種子および発芽中の植物を植物病原性真菌から保護するための、種子を処理するための本発明による組成物の使用に関する。さらには本発明は、植物病原性真菌からの保護のための、本発明による組成物を使用して処理された種子に関する。

【0059】

出芽後の植物に損傷を与える植物病原性真菌の防除は、土壌および植物の地上部を作物保護組成物を使用して処理することにより、主に行われる。環境ならびにヒトおよび動物の健康に対する作物保護組成物の潜在的な影響に関する懸念のため、施用される活性化合物の量を低減させるための試みがある。
50

【0060】

本発明の利点の1つは、本発明による組成物の特有の浸透移行性のため、これらの組成物を使用した種子の処理が種子自身だけでなく結果として得られる出芽後の植物をも植物病原性真菌から保護する点である。こうして、播種時またはその直後の作物の即時処理を省くことができる。

【0061】

本発明による混合物を、その種子から成長する植物が有害生物に対して作用するタンパク質を発現する能力がある遺伝子導入種子のためにもとりわけ用いることができることも、有利であると考えられる。本発明による活性化化合物の組み合わせまたは組成物を使用したかかる種子の処理により、例えば殺虫性タンパク質の発現によってさえ、ある種の有害生物は防除され得る。驚くべきことに、ここでさらなる相乗効果が観察されることがあり、この相乗効果は有害生物による攻撃に対する保護の有効性をさらに向上させる。

10

【0062】

本発明による組成物は、農業において、温室において、森林においてまたは園芸もしくはブドウ栽培において使用される任意の植物品種の種子を保護するのに適している。とりわけ、これは、穀物（例えばコムギ、オオムギ、ライムギ、ライコムギ、キビ、カラスムギなど）、トウモロコシ（コーン）、ワタ、ダイズ、イネ、ジャガイモ、ヒマワリ、インゲンマメ、コーヒー、ビート（例としてテンサイおよび飼料ビート）、ピーナッツ、アブラナ、ケシ、オリーブ、ココナツ、カカオ、サトウキビ、タバコ、野菜（例えばトマト、キュウリ、タマネギおよびレタスなど）、芝生および観賞植物の種子の形態をとる（下も参照されたい）。穀物（例えばコムギ、オオムギ、ライムギ、ライコムギおよびカラスムギなど）、トウモロコシ（コーン）およびイネの種子の処理は、とりわけ重要である。

20

【0063】

さらに下にも記載されるように、本発明による活性化化合物の組み合わせまたは組成物を使用した遺伝子導入種子の処理は、とりわけ重要である。このことは、殺虫性を持つポリペプチドまたはタンパク質の発現を可能にする少なくとも1の異種遺伝子を含有する植物の種子に言い及ぶ。遺伝子導入種子中の異種遺伝子は、例えばバチルス属（*Bacillus*）、リゾビウム属（*Rhizobium*）、シュードモナス属（*Pseudomonas*）、セラチア属（*Serratia*）、トリコデルマ属（*Trichoderma*）、クラビバクター属（*Clavibacter*）、グロムス属（*Glomus*）またはグリオクラジウム属（*Gliocladium*）の種の微生物を起源とすることができる。好ましくは、この異種遺伝子はバチルス属種からのものであり、この遺伝子産物はヨーロッパアワノメイガ（*European corn borer*）および/またはウェスタンコーンルートワーム（*Western corn rootworm*）に対して活性がある。とりわけ好ましくは、異種遺伝子はバチルス・チューリンゲンシスを起源とする。

30

【0064】

本発明との関連で、本発明による活性化化合物の組み合わせまたは組成物は、単独でまたは好適な製剤中で種子に施用される。好ましくは、種子は、処理が何らかの損傷を引き起こさないように十分に安定な状態で処理される。一般的に、種子の処理は、収穫から播種の間の任意の時点でなされ得る。通常、用いられる種子は、植物から分離され、穂軸、殻、柄、皮、毛または果肉を除去される。それゆえに、例えば、収穫、浄化および乾燥させて水分含量を15重量%未満まで下げた種子を用いることが可能である。あるいは、乾燥後、例えば水で処理して次いで再度乾燥させた種子を用いることもまた可能である。

40

【0065】

種子を処理する際、一般に、種子に施用される本発明による組成物の量および/またはさらなる添加剤の量は、種子の発芽に悪影響を与えないように、または結果として得られる植物が損傷されないように選ばれることに注意しなければならない。このことは、ある一定の施用量で植物毒性作用を持ち得る活性化化合物の場合、とりわけ念頭に置かれなければならない。

【0066】

50

本発明による組成物は、直接的に、すなわちさらなる構成成分を含むことなく、および希釈されることなく、施用することができる。一般的に、好適な製剤の形態で組成物を種子に施用するのが好ましい。種子の処理に適している製剤および方法は当業者に公知であり、例えば、以下の資料：US 4, 272, 417 A、US 4, 245, 432 A、US 4, 808, 430 A、US 5, 876, 739 A、US 2003/0176428 A1、WO 2002/080675 A1、WO 2002/028186 A2中に記載されている。

【0067】

本発明に従って用いることができる活性化化合物の組み合わせは、慣例的な種子粉衣製剤、例えば溶液、エマルジョン、懸濁剤、散剤、フォーム、スラリーまたは他の種子用コーティング材料、ならびにまたULV製剤などに変換することができる。

10

【0068】

これらの製剤は、公知の様式で、活性化化合物または活性化化合物の組み合わせを慣例的な添加剤、例えば慣例的な増量剤、およびまた溶媒または希釈剤、着色剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、脱泡剤、保存剤、二次増粘剤、粘着剤、ジベレリンと、および同様に水と混合することにより調製される。

【0069】

本発明に従って用いることができる種子粉衣製剤中に存在し得る好適な着色剤は、かかる目的のために慣例的である全ての着色剤を包含する。水溶性が足りない顔料、および水溶性である染料の両方について使用がなされ得る。言及され得る例としては、Rhodamine B、C.I. Pigment Red 112およびC.I. Solvent Red 1という名称で知られている着色剤が挙げられる。

20

【0070】

本発明に従って用いることができる種子粉衣製剤中に存在し得る好適な湿潤剤は、湿潤を促進し、活性農薬物質の製剤中で慣例的である全ての物質を包含する。好ましくは、アルキルナフタレン-スルホネート、例えばジイソプロピル-スルホネートまたはジイソブチルナフタレン-スルホネートなどを用いることが可能である。

【0071】

本発明に従って用いることができる種子粉衣製剤中に存在し得る好適な分散剤および/または乳化剤は、活性農薬物質の製剤中で慣例的である全ての非イオン性、アニオン性およびカチオン性の分散剤を包含する。好ましくは、非イオン性もしくはアニオン性の分散剤または非イオン性もしくはアニオン性の分散剤の混合物を用いることが可能である。とりわけ好適な非イオン性分散剤は、エチレンオキシド-プロピレンオキシドブロックポリマー、アルキルフェノールポリグリコールエーテル、およびトリスチリルフェノールポリグリコールエーテル、ならびにそれらのリン酸化誘導体または硫酸化誘導体である。とりわけ好適なアニオン性分散剤は、リグノスルホネート、ポリアクリル酸塩、およびアリアルスルホネート-ホルムアルデヒド縮合物である。

30

【0072】

本発明に従って用いられるものである種子粉衣製剤中に存在し得る脱泡剤は、農薬活性化化合物の製剤中で慣例的である全ての泡抑制化合物を包含する。好ましいのは、シリコン脱泡剤、ステアリン酸マグネシウム、シリコンエマルジョン、長鎖アルコール、脂肪酸およびそれらの塩ならびにまた有機フッ素化合物ならびにまたそれらの混合物を用いることである。

40

【0073】

本発明に従って用いられるものである種子粉衣製剤中に存在し得る保存剤は、農薬組成物中での目的のために用いることができる全ての化合物を包含する。例として、ジクロロフェンおよびベンジルアルコールヘミホルマールに言及がなされ得る。

【0074】

本発明に従って用いられるものである種子粉衣製剤中に存在し得る二次増粘剤は、農薬組成物中での目的のために用いることができる全ての化合物を包含する。好ましいの

50

は、セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、多糖、例えばキサンタンガムまたはV e e g u mなど、改質粘土、フィロシリケート、例えばアタパルジャイトおよびペントナイトなど、ならびにまた微細ケイ酸である。

【0075】

本発明に従って用いられるものである種子粉衣製剤中に存在し得る好適な粘着剤は、種子粉衣中で用いることができる全ての慣例的なバインダーを包含する。ポリビニルピロリドン、ポリビニルアセテート、ポリビニルアルコールおよびチロースが好ましいものとして言及され得る。

【0076】

本発明に従って用いられるものである種子粉衣製剤中に存在し得る好適なジベレリンは、好ましくはジベレリンA1、A3 (=ジベレリン酸)、A4およびA7であり；とりわけ好ましいのはジベレリン酸を用いることである。ジベレリンは公知である(R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schadlingsbekämpfungsmittel" [Chemistry of Crop Protection Agents and Pesticides], Vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401 - 412を参照されたい)。

10

【0077】

本発明に従って用いることができる種子粉衣製剤は、非常に幅広い種類のタイプのうちの任意の種子を処理するため、直接的にまたは予め水で希釈した後に用いられ得る。本発明に従って用いることができる種子粉衣製剤またはそれらの希釈調合剤はまた、遺伝子導入植物の種子を粉衣するためにも用いられ得る。本発明との関連で、発現により形成される物質との相互作用で相乗効果が生じることもある。

20

【0078】

本発明に従って用いることができる種子粉衣製剤または水を加えることによりそれらから調製される調合剤を使用して種子を処理するための好適な混合装置は、粉衣のために慣例的に用いることができる全ての混合装置を包含する。粉衣の際に採用される具体的な手順は、種子をミキサー内に導入すること、特定の所望量の種子粉衣製剤をそのまままたは予め水で希釈した後に加えること、および製剤が種子上に均一に分散されるまで混合を行うことを含む。場合により、乾燥操作がこの後に続く。

30

【0079】

本発明による活性化合物または組成物は、強い殺微生物活性を持ち、作物保護および材料保護において、望まれない微生物、例えば真菌および細菌などを防除するために用いることができる。

【0080】

作物保護において、殺真菌剤は、ネコブカビ類(Plasmodiophoromycetes)、卵菌類(Oomycetes)、ツボカビ類(Chytridiomycetes)、接合菌類(Zygomycetes)、子のう菌類(Ascomycetes)、担子菌類(Basidiomycetes)および不完全菌類(Deuteromycetes)を防除するために用いることができる。

40

【0081】

作物保護において、殺菌剤は、シュードモナス科(Pseudomonadaceae)、リゾビウム科(Rhizobiaceae)、腸内細菌科(Enterobacteriaceae)、コリネバクテリウム科(Corynebacteriaceae)およびストレプトマイセス科(Streptomycetaceae)を防除するために用いることができる。

【0082】

本発明による殺真菌性組成物は、植物病原性真菌の治療的または保護的防除のために用いることができる。したがって、本発明はまた、本発明による活性化合物の組み合わせまたは組成物を用いて植物病原性真菌を防除するための治療的および保護的方法に関し、こ

50

ここでこの組み合わせまたは組成物は種子、植物または植物部分、果実または植物が生育する土壌に施用される。好ましいのは、植物または植物部分、果実または植物が生育する土壌に対する施用である。

【0083】

作物保護において植物病原性真菌を駆除するための本発明による組成物は、活性があるものの非植物毒性である量の本発明による化合物を含む。「活性があるものの非植物毒性である量」は、真菌に起因する植物病を防除または完全に死滅させるのに十分であって、同時に注目すべき植物毒性症状を呈さない本発明による組成物の量を意味するものである。これらの施用量は、一般に、より広い範囲内で変わり得るものであり、この量は、いくつかの因子、例として植物病原性真菌、植物または作物、気候条件および本発明による組成物の成分に依存する。

10

【0084】

活性化化合物が植物病を防除するために必要とされる濃度において植物により良好に耐容されるという事実は、空中の植物部分の、栄養繁殖材料および種子の、ならびに土壌の処理を可能にする。

【0085】

本発明によると、全ての植物および植物部分を処理することができる。植物とは、全ての植物および植物集団、例えば望ましいおよび望ましくない野生植物、栽培品種および植物品種などを意味する（植物品種により、または植物育成者権により保護可能か否かにかかわらず）。栽培品種および植物品種は、1または複数のバイオテクノロジー法により、例えば倍加半数体、プロトプラスト融合、ランダム突然変異誘発および定方向突然変異誘発、分子マーカーもしくは遺伝子マーカーの使用により、または生物工学的な方法および遺伝子工学的な方法により援助または補うことができる慣用的な繁殖法および育種法によって得られる植物であることができる。植物部分とは、植物の全ての地上および地下の部分および器官、例えば新芽、葉、花および根などを意味し、これにより例えば葉、針葉、茎、枝、花、子実体、果実および種子、同様に根、塊茎、球茎および根茎が列挙される。作物ならびに栄養繁殖材料および生殖繁殖材料、例えば切穂、球茎、根茎、塊茎、匍匐茎および種子もまた植物部分に属する。

20

【0086】

本発明の活性化化合物は、良好な植物耐容性および温血動物に対する好都合な毒性および環境に良好に耐容されることと相まって、植物および植物器官の保護に、収穫量の増加に、収穫材料の品質の改良に適している。それらは、好ましくは作物保護剤として使用され得る。それらは、通常は感受性の種および抵抗性の種に対して、ならびに全てのまたはいくつかの発生ステージに対して活性がある。

30

【0087】

本発明による方法により保護することができる植物の中で、言及がなされ得るのは、コーン、ダイズ、ワタ、ブラシカ属 (*Brassica*) 油料種子、例えばブラシカ・ナプス (*Brassica napus*) (例としてキャノーラ)、ブラシカ・ラパ (*Brassica rapa*)、*B. juncea* (例としてマスタード) およびブラシカ・カリナタ (*Brassica carinata*) など、イネ、コムギ、テンサイ、サトウキビ、カラスムギ、ライムギ、オオムギ、キビ、ライコムギ、アマ、ブドウのような主要農作物、ならびに様々な植物学的分類の様々な果実および野菜、例えばバラ科植物 (*Rosaceae* sp.) (例えば種子果 (pip fruit)、例えばリンゴおよびナシなど、これらだけでなく核果、例えばアンズ、サクランボ、アーモンドおよびモモなど、ならびに液果、例えばイチゴなど)、リベシオイダエ科植物 (*Ribesioideae* sp.)、クルミ科植物 (*Juglandaceae* sp.)、カバノキ科植物 (*Betulaceae* sp.)、ウルシ科植物 (*Anacardiaceae* sp.)、ブナ科植物 (*Fagaceae* sp.)、クワ科植物 (*Moraceae* sp.)、モクセイ科植物 (*Oleaceae* sp.)、マタタビ科植物 (*Actinidiaceae* sp.)、クスノキ科植物 (*Lauraceae* sp.)、

40

50

バショウ科植物 (Musaceae sp.) (例えばバナナの木および植栽)、アカネ科植物 (Rubiaceae sp.) (例えばコーヒー)、ツバキ科植物 (Theaceae sp.)、アオギリ科植物 (Sterculiaceae sp.)、ミカン科植物 (Rutaceae sp.) (例えばレモン、オレンジおよびグレープフルーツ); ナス科植物 (Solanaceae sp.) (例えばトマト、ジャガイモ、コショウ、ナス)、ユリ科植物 (Liliaceae sp.)、キク科植物 (Compositae sp.) (例えばレタス、アーティチョークおよびチコリー - ルートチコリー (root chicory)、エンダイブまたはカモンチコリー (common chicory) など)、セリ科植物 (Umbelliferae sp.) (例えばニンジン、パセリ、セロリおよびセルリアック)、ウリ科植物 (Cucurbitaceae sp.) (例えばキュウリ - ピックルキュウリ (pickling cucumber)、カボチャ、スイカ、ヒョウタンおよびメロンなど)、ネギ科植物 (Alliaceae sp.) (例えばタマネギおよびニラ)、アブラナ科植物 (Cruciferae sp.) (例えばホワイトキャベツ、レッドキャベツ、ブロッコリー、カリフラワー、芽キャベツ、チンゲンサイ、コールラビ、ラディッシュ、セイヨウワサビ、クレソン、白菜)、マメ科植物 (Leguminosae sp.) (例えばピーナッツ、エンドウマメおよびマメ類 - 例えばクライミングビーン (climbing bean) およびソラマメなど)、アカザ科植物 (Chenopodiaceae sp.) (例えばマンゴーロッド、フダンソウ (spinach beet)、ハウレンソウ、ビートルート)、アオイ科 (Malvaceae) (例えばオクラ)、クサスギカズラ科 (Asparagaceae) (例えばアスパラガス); 園芸作物および森林作物; 観賞植物; 同様にこれらの作物の遺伝子改変相同体である。

10

20

【0088】

特定の実施形態において、本発明による方法によって保護することができる植物は、ワタ、ブドウ、穀物 (例えばコムギ、イネ、オオムギ、ライコムギなど)、トウモロコシ (コーン)、ダイズ、アブラナ、ヒマワリ、芝、園芸作物、低木、果樹および果実植物 (例えばリンゴの木、ナシの木 (pear-tree)、柑橘類、バナナ、コーヒーの木、イチゴ植物、ラズベリー植物など)、野菜の中から、とりわけ穀物、コーン、アブラナ、低木、果樹および果実植物、野菜およびブドウの中から選択される。

【0089】

本発明によると、全ての植物および植物部分を処理することができる。植物とは、全ての植物および植物集団、例えば望ましいおよび望ましくない野生植物、栽培品種および植物品種などを意味する (植物品種により、または植物育成者権により保護可能か否かにかかわらず)。栽培品種および植物品種は、1または複数のバイオテクノロジー法により、例えば倍加半数体、プロトプラスト融合、ランダム突然変異誘発および定方向突然変異誘発、分子マーカーもしくは遺伝子マーカーの使用により、または生物工学的な方法および遺伝子工学的な方法により援助または補うことができる慣用的な繁殖法および育種法によって得られる植物であることができる。植物部分とは、植物の全ての地上および地下の部分および器官、例えば新芽、葉、花および根などを意味し、これにより例えば葉、針葉、茎、枝、花、子実体、果実および種子、同様に根、球茎および根茎が列挙される。作物ならびに栄養繁殖材料および生殖繁殖材料、例えば切穂、球茎、根茎、匍匐茎および種子もまた植物部分に属する。

30

40

【0090】

本発明による処理方法は、遺伝子改変生物 (GMO)、例として植物または種子の処理において用いることができる。遺伝子改変植物 (または遺伝子導入植物) は、異種遺伝子がゲノム内に安定的に組み込まれている植物である。表現「異種遺伝子」は、本質的に、植物外で供給または構築される遺伝子であって、核、葉緑体またはミトコンドリアのゲノム内に導入されたときに、目的のタンパク質もしくはポリペプチドを発現させることにより、または植物内に存在する他の遺伝子 (複数可) を (例えばアンチセンス技術、コサプレクション技術、RNA干渉 - RNAi - 技術またはマイクロRNA - miRNA - 技術

50

を用いて) ダウンレギュレートもしくはサイレンシングすることにより、形質転換植物に新たなまたは改良された農学的または他の性質を与える遺伝子を意味する。ゲノム内に位置する異種遺伝子はまた、導入遺伝子とも呼ばれる。植物ゲノム内のその特定の位置により定義される導入遺伝子は、形質転換または遺伝子導入イベントと呼ばれる。

【0091】

植物種または植物栽培品種、それらの位置および成長条件(土壌、気候、生育期間、栄養)に依存して、本発明による処理はまた、相加を超えた(「相乗的な」)効果をもたらし得る。それゆえに、例えば、本発明に従って用いることができる活性化化合物および組成物の施用量の低減および/または活性スペクトルの広幅化および/または活性の向上、より良好な植物成長、高温または低温に対する耐性の向上、渇水に対するまたは水もしくは土壌の塩分含量に対する耐性の向上、開花性能の向上、より容易な収穫、熟成加速、より多い収穫量、より大きな果実、より高い植物高、より濃い緑色の葉色、より早期の開花、収穫生産物のより高い品質および/またはより高い栄養価、果実内のより高い糖濃度、収穫生産物のより良好な保存安定性および/または加工性が可能であり、これらは実際に予想された効果を超えるものである。

【0092】

ある施用量において、本発明による活性化化合物の組み合わせはまた、植物において強化効果を持つ。したがって、それらはまた、望まれない微生物による攻撃に対する植物の防御系を動員するのにも適している。これは、適切な場合、本発明による組み合わせの、例えば真菌に対する増強された活性の理由の1つであり得る。植物強化(抵抗性誘導)物質は、本発明との関連で、望まれない微生物を続けて接種したときに処理された植物がこれらの微生物に対して実質的な程度の抵抗性を呈するように植物の防御系を刺激する能力がある物質または物質の組み合わせをも意味すると理解されるものである。この場合、望まれない微生物は、植物病原性真菌、細菌およびウイルスを意味すると理解されるものである。それゆえに、本発明による物質は、処理後一定の時間内、上述の病原体による攻撃から植物を保護するために使用することができる。保護が有効である時間は、一般に、活性化化合物を使用した植物の処理後1から28日、好ましくは1から14日に及ぶ。

【0093】

本発明に従って好ましく処理されるものである植物および植物栽培品種は、とりわけ有利で有用な形質をこれらの植物に付与する遺伝材料を持つ全ての植物(育種および/またはバイオテクノロジー手段により得られたものであっても)を包含する。

【0094】

本発明に従ってまた好ましく処理されるものである植物および植物栽培品種は、1または複数の生物ストレスに対して抵抗性であり、すなわち前記植物は有害動物および有害微生物に対して、例えば線虫、昆虫、ダニ、植物病原性真菌、細菌、ウイルスおよび/またはウイロイドなどに対してより良好な防御力を示す。

【0095】

線虫抵抗性植物の例は、例として米国特許出願第11/765,491号、第11/765,494号、第10/926,819号、第10/782,020号、第12/032,479号、第10/783,417号、第10/782,096号、第11/657,964号、第12/192,904号、第11/396,808号、第12/166,253号、第12/166,239号、第12/166,124号、第12/166,209号、第11/762,886号、第12/364,335号、第11/763,947号、第12/252,453号、第12/209,354号、第12/491,396号、第12/497,221号、第12/644,632号、第12/646,004号、第12/701,058号、第12/718,059号、第12/721,595号、第12/638,591号中に、およびWO11/002992、WO11/014749、WO11/103247、WO11/103248中に記載されている。

【0096】

本発明に従ってまた処理され得る植物および植物栽培品種は、1または複数の非生物

10

20

30

40

50

ストレスに対して抵抗性である植物である。非生物ストレス条件として、例えば、渇水、低温曝露、熱曝露、浸透圧ストレス、湛水、土壌塩分の増加、ミネラル曝露の増加、オゾン曝露、強い光曝露、窒素栄養分の限定的利用性、リン栄養分の限定的利用性、日陰回避を挙げ得る。

【0097】

本発明に従ってまた処理され得る植物および植物栽培品種は、増強された収量特性を特徴とする植物である。前記植物における収量増加は、例えば、植物の生理機能、成長および発達の改良、例えば水の使用効率、水の保持効率、窒素使用の改良、炭素同化の増強、光合成の改良、発芽効率の向上ならびに熟成加速などの結果であることができる。収量はさらには（ストレスおよび非ストレス条件下での）植物構成の改良により影響されることがあり、この植物構成の改良としては、限定されるものではないが、早期の開花、雑種子生産のための開花制御、苗の生長力、植物の大きさ、節間数および距離、根の成長、種子の大きさ、果実の大きさ、さやの大きさ、さやまたは穂の数、さやまたは穂あたりの種子数、種子の質量、種子登熟の増進、種子飛散の低減、さや裂開の低減および倒伏抵抗性が挙げられる。さらなる収率形質として、種子の組成、例えば炭水化物含量、タンパク質含量、油含量および油組成、栄養価、アンチニュートリエント化合物の低減、加工性の改良およびより良好な保存安定性などが挙げられる。

【0098】

本発明に従って処理され得る植物は、一般により多い収量、生長力、健康ならびに生物学的および非生物学的ストレスに対する抵抗性をもたらすヘテロシス、つまり雑種強勢の特性を既に発現している雑種植物である。かかる植物は、典型的に、近交系の雄性不稔親系統（雌性親）を別の近交系の雄性稔性親系統（雄性親）と交雑させることにより作られる。雑種子は典型的に雄性不稔植物から収穫され、栽培者に販売される。雄性不稔植物は、雄穂除去、すなわち雄性生殖器官（つまり雄花）の機械的除去により（例としてコーンにおいて）時に生産することができるが、より典型的には、雄性不稔は、植物ゲノム内の遺伝的決定因子の結果である。その場合、および特に種子が雑種植物から収穫される所望の生産物である場合、雑種植物において雄性稔性が完全に回復するのを確実にすることが典型的に有用である。これは、雄性親が、雄性不稔に關与する遺伝的決定因子を含有する雑種植物において雄性稔性を回復させる能力がある適切な稔性回復遺伝子を持つことを確実にすることにより、達成することができる。雄性不稔の遺伝的決定因子は、細胞質内に位置し得る。細胞質雄性不稔（CMS）の例は、例えば、ブラシカ属種（*Brassica species*）において記載された（WO92/05251、WO95/09910、WO98/27806、WO05/002324、WO06/021972およびUS6,229,072）。しかしながら、雄性不稔の遺伝的決定因子はまた、核ゲノム内に位置することもできる。雄性不稔植物はまた、植物バイオテクノロジー法、例えば遺伝子操作などによっても得ることができる。雄性不稔植物を得るのにとりわけ有用な手段は、WO89/10396中に記載されており、ここでは、例えば、リボヌクレアーゼ、例えばバルナーゼなどを雄ずい中のタペータム細胞において選択的に発現させる。次いで、タペータム細胞内でのリボヌクレアーゼ阻害剤、例えばバルスターなどの発現により、稔性を回復させることができる（例としてWO91/02069）。

【0099】

本発明に従って処理され得る植物または植物栽培品種（植物バイオテクノロジー法、例えば遺伝子操作などにより得られるもの）は、除草剤耐性植物、すなわち1または複数の所定の除草剤に対して耐性にされた植物である。かかる植物は、遺伝子形質転換により、またはかかる除草剤耐性を付与する変異を含有する植物の選抜により得ることができる。

【0100】

除草剤抵抗性植物は、例えばグリホサート耐性植物、すなわち除草剤グリホサートまたはその塩に耐性にされた植物である。植物は、異なる手段を通じて、グリホサートに対して耐性にすることができる。例えば、グリホサート耐性植物は、酵素5-エノールピルピルシキメート-3-ホスフェートシンターゼ（EPSPS）をコードする遺伝子で植物を

形質転換することにより得ることができる。かかるEPSPS遺伝子の例は、細菌サルモネラ・チフィムリウム (*Salmonella typhimurium*) のAroA遺伝子 (変異CT7) (Comai et al., 1983, Science, 221, 370-371)、細菌アグロバクテリウム属種 (*Agrobacterium sp.*) のCP4遺伝子 (Barry et al., 1992, Curr. Topics Plant Physiol. 7, 139-145)、ペチュニアのEPSPSをコードする遺伝子 (Shah et al., 1986, Science 233, 478-481)、トマトのEPSPSをコードする遺伝子 (Gasser et al., 1988, J. Biol. Chem. 263, 4280-4289)、またはエレウシネ属 (*Eleusine*) のEPSPSをコードする遺伝子 (WO01/66704) である。それはまた、例えばEP0837944、WO00/66746、WO00/66747、WO02/26995、WO11/000498中に記載されているように、変異EPSPSであることもできる。グリホサート耐性植物はまた、米国特許第5,776,760号および第5,463,175号中に記載されているように、グリホサートオキシドレクターゼ酵素をコードする遺伝子を発現させることにより得ることもできる。グリホサート耐性植物はまた、例えばWO02/36782、WO03/092360、WO05/012515およびWO07/024782中に記載されているように、グリホサートアセチルトランスフェラーゼ酵素をコードする遺伝子を発現させることにより得ることもできる。グリホサート耐性植物はまた、例えばWO01/024615またはWO03/013226中に記載されているように、上述の遺伝子の自然発生変異を含有する植物を選抜することにより得ることもできる。グリホサート耐性を授けるEPSPS遺伝子を発現する植物は、例として米国特許出願第11/517,991号、第10/739,610号、第12/139,408号、第12/352,532号、第11/312,866号、第11/315,678号、第12/421,292号、第11/400,598号、第11/651,752号、第11/681,285号、第11/605,824号、第12/468,205号、第11/760,570号、第11/762,526号、第11/769,327号、第11/769,255号、第11/943801号または第12/362,774中に記載されている。グリホサート耐性を授ける他の遺伝子、例えばデカルボキシラーゼ遺伝子を発現する植物は、例として米国特許出願第11/588,811号、第11/185,342号、第12/364,724号、第11/185,560号または第12/423,926号中に記載されている。

【0101】

他の除草剤抵抗性植物は、例えば、酵素グルタミシンターゼを阻害する除草剤、例えばピアラホス、ホスフィノトリシンまたはグルホシネートなどに対して耐性にされた植物である。かかる植物は、例として米国特許出願第11/760,602号中に記載されているように、除草剤を解毒する酵素または阻害に対して抵抗性である変異グルタミシンターゼ酵素を発現させることにより得ることができる。1のかかる効率的な解毒酵素は、ホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼをコードする酵素 (例えばストレプトマイセス属種 (*Streptomyces species*) からのbarまたはpatタンパク質など) である。外因性のホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼを発現する植物は、例えば米国特許第5,561,236号; 第5,648,477号; 第5,646,024号; 第5,273,894号; 第5,637,489号; 第5,276,268号; 第5,739,082号; 第5,908,810号および第7,112,665号中に記載されている。

【0102】

さらなる除草剤耐性植物はまた、酵素ヒドロキシフェニルピルベートジオキシゲナーゼ (HPPD) を阻害する除草剤に対して耐性にされた植物である。HPPDは、パラ-ヒドロキシフェニルピルベート (HPP) をホモゲンチセートに変換する反応を触媒する酵素である。HPPD阻害剤に対して耐性である植物は、WO96/38567、WO99/24585、WO99/24586、WO2009/144079、WO2002/0

10

20

30

40

50

4 6 3 8 7 または U S 6 , 7 6 8 , 0 4 4 、 W O 1 1 / 0 7 6 8 7 7 、 W O 1 1 / 0 7 6 8 8 2 、 W O 1 1 / 0 7 6 8 8 5 、 W O 1 1 / 0 7 6 8 8 9 、 W O 1 1 / 0 7 6 8 9 2 中に記載されているように、自然発生の抵抗性 H P P D 酵素をコードする遺伝子、または変異もしくはキメラの H P P D 酵素をコードする遺伝子で形質転換することができる。H P P D 阻害剤に対する耐性はまた、H P P D 阻害剤による野生型 H P P D 酵素の阻害にもかかわらずホモゲンチセートの形成を可能にするある種の酵素をコードする遺伝子で植物を形質転換することにより得ることもできる。かかる植物および遺伝子は、W O 9 9 / 3 4 0 0 8 および W O 0 2 / 3 6 7 8 7 中に記載されている。H P P D 阻害剤に対する植物の耐性はまた、W O 2 0 0 4 / 0 2 4 9 2 8 中に記載されているように、H P P D 耐性酵素をコードする遺伝子に加えてプレフェネートデスヒドロゲナーゼ (d e s h y d r o g e n a s e) (P D H) 活性を持つ酵素をコードする遺伝子で植物を形質転換することにより改良することもできる。さらに、H P P D 阻害剤を代謝または分解する能力がある酵素、例えば W O 2 0 0 7 / 1 0 3 5 6 7 および W O 2 0 0 8 / 1 5 0 4 7 3 中に示されている C Y P 4 5 0 酵素をコードする遺伝子をそのゲノム内に加えることにより、植物を H P P D 阻害剤の除草剤に対してより耐性にすることができる。

【 0 1 0 3 】

なおさらなる除草剤抵抗性植物は、アセトラクテートシンターゼ (A L S) 阻害剤に対して耐性にされた植物である。公知の A L S 阻害剤としては、例えば、スルホニルウレア、イミダゾリノン、トリアゾロピリミジン、プリイミジニオキシ (チオ) ベンゾエート (p r y i m i d i n y o x y (t h i o) b e n z o a t e) および / またはスルホニルアミノカルボニルトリアゾリノン除草剤が挙げられる。A L S 酵素 (アセトヒドロキシ酸シンターゼ、A H A S としても知られる) 中の異なる変異は、例えば T r a n e l および W r i g h t (2 0 0 2 , W e e d S c i e n c e 5 0 : 7 0 0 - 7 1 2) 中に、それだけでなく米国特許第 5 , 6 0 5 , 0 1 1 号、第 5 , 3 7 8 , 8 2 4 号、第 5 , 1 4 1 , 8 7 0 号および第 5 , 0 1 3 , 6 5 9 号中にも記載されているように、異なる除草剤および除草剤群に対する耐性を授けることが知られている。スルホニルウレア耐性植物およびイミダゾリノン耐性植物の生産は、米国特許第 5 , 6 0 5 , 0 1 1 号 ; 第 5 , 0 1 3 , 6 5 9 号 ; 第 5 , 1 4 1 , 8 7 0 号 ; 第 5 , 7 6 7 , 3 6 1 号 ; 第 5 , 7 3 1 , 1 8 0 号 ; 第 5 , 3 0 4 , 7 3 2 号 ; 第 4 , 7 6 1 , 3 7 3 号 ; 第 5 , 3 3 1 , 1 0 7 号 ; 第 5 , 9 2 8 , 9 3 7 号および第 5 , 3 7 8 , 8 2 4 号 ; ならびに国際公開 W O 9 6 / 3 3 2 7 0 中に記載されている。他のイミダゾリノン耐性植物もまた、W O 2 0 0 4 / 0 4 0 0 1 2 、 W O 2 0 0 4 / 1 0 6 5 2 9 、 W O 2 0 0 5 / 0 2 0 6 7 3 、 W O 2 0 0 5 / 0 9 3 0 9 3 、 W O 2 0 0 6 / 0 0 7 3 7 3 、 W O 2 0 0 6 / 0 1 5 3 7 6 、 W O 2 0 0 6 / 0 2 4 3 5 1 および W O 2 0 0 6 / 0 6 0 6 3 4 中に記載されている。さらなるスルホニルウレア耐性植物およびイミダゾリノン耐性植物もまた、例えば W O 0 7 / 0 2 4 7 8 2 、 W O 1 1 / 0 7 6 3 4 5 、 W O 2 0 1 2 0 5 8 2 2 3 および米国特許出願第 6 1 / 2 8 8 9 5 8 号中に記載されている。

【 0 1 0 4 】

イミダゾリノンおよび / またはスルホニルウレアに対して耐性である他の植物は、例えばダイズについて米国特許第 5 , 0 8 4 , 0 8 2 号中に、イネについて W O 9 7 / 4 1 2 1 8 中に、テンサイについて米国特許第 5 , 7 7 3 , 7 0 2 号および W O 9 9 / 0 5 7 9 6 5 中に、レタスについて米国特許第 5 , 1 9 8 , 5 9 9 号中に、またはヒマワリについて W O 0 1 / 0 6 5 9 2 2 中に記載されているように、誘導された突然変異誘発により、除草剤の存在下での細胞培養における選抜により、または突然変異育種により得ることができる。

【 0 1 0 5 】

本発明に従ってまた処理され得る植物または植物栽培品種 (植物バイオテクノロジー法、例えば遺伝子操作などにより得られるもの) は、昆虫抵抗性遺伝子導入植物、すなわちある種の標的昆虫による攻撃に対して抵抗性にされた植物である。かかる植物は、遺伝子形質転換により、またはかかる昆虫抵抗性を付与する変異を含有する植物の選抜により得

10

20

30

40

50

ることができる。

【0106】

本明細書中で用いられる「昆虫抵抗性遺伝子導入植物」は、以下をコードするコーディング配列を含む少なくとも1の導入遺伝子を含む任意の植物を包含する：

1) バチルス・チューリングゲンシスからの殺虫性結晶タンパク質もしくはその殺虫性部分、例えばCrickmoreらにより収載され(1998, Microbiology and Molecular Biology Reviews, 62: 807-813)、Crickmoreら(2005)によりバチルス・チューリングゲンシス毒素命名法において更新された、http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/でオンラインである殺虫性結晶タンパク質、もしくはその殺虫性部分など、例として、Cryタンパク質のクラスCry1Ab、Cry1Ac、Cry1B、Cry1C、Cry1D、Cry1F、Cry2Ab、Cry3AaもしくはCry3Bbであるタンパク質もしくはその殺虫性部分(例としてEP1999141およびWO2007/107302)、もしくは例として米国特許出願第12/249,016号中に記載されているような合成遺伝子によりコードされるかかるタンパク質；または

2) バチルス・チューリングゲンシスからの第二の他の結晶タンパク質もしくはその部分の存在下で殺虫性であるバチルス・チューリングゲンシスからの結晶タンパク質もしくはその部分、例えばCry34およびCry35結晶タンパク質から形成されるバイナリートキシン(Moellenbeck et al., 2001, Nat. Biotechnol. 19: 668-72; Schnepf et al., 2006, Applied Environm. Microbiol. 71, 1765-1774)、もしくは、Cry1AもしくはCry1Fタンパク質とCry2AaもしくはCry2AbもしくはCry2Aeタンパク質とから形成されるバイナリートキシン(米国特許出願第12/214,022号およびEP08010791.5)など；または

3) バチルス・チューリングゲンシスからの異なる殺虫性結晶タンパク質の一部を含むハイブリッド殺虫性タンパク質、例えば上記1)のタンパク質のハイブリッドもしくは上記2)のタンパク質のハイブリッドなど、例として、コーンイベントMON98034により生産されるCry1A.105タンパク質(WO2007/027777)；または

4) 上記1)から3)のうちのいずれか1のタンパク質であって、標的昆虫種に対するより高い殺虫活性を得るために、および/もしくは作用する標的昆虫種の範囲を拡大するために、および/もしくはクローニングもしくは形質転換中にコーディングDNA内に導入された変化が原因で、いくつか、とりわけ1から10個のアミノ酸が別のアミノ酸により置き換えられたタンパク質、例えばコーンイベントMON863もしくはMON88017におけるCry3Bb1タンパク質、もしくはコーンイベントMIR604におけるCry3Aタンパク質など；または

5) バチルス・チューリングゲンシスもしくはバチルス・セレウス(Bacillus cereus)からの殺虫性分泌タンパク質もしくはその殺虫性部分、例えばhttp://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.htmlに収載されている栄養成長期殺虫性タンパク質(VIP)など、例として、VIP3Aaタンパク質クラスからのタンパク質；または

6) バチルス・チューリングゲンシスもしくはバチルス・セレウスからの第二の分泌タンパク質の存在下で殺虫性である、バチルス・チューリングゲンシスもしくはバチルス・セレウスからの分泌タンパク質、例えばVIP1AおよびVIP2Aタンパク質から形成されるバイナリートキシン(WO94/21795)など；または

7) バチルス・チューリングゲンシスもしくはバチルス・セレウスからの異なる分泌タンパク質からの一部を含むハイブリッド殺虫性タンパク質、例えば上記1)におけるタンパク質のハイブリッドもしくは上記2)におけるタンパク質のハイブリッドなど；または

8) 上記5)から7)のうちのいずれか1のタンパク質であって、標的昆虫種に対するより高い殺虫活性を得るために、および/もしくは作用する標的昆虫種の範囲を拡大するた

10

20

30

40

50

めに、および／もしくは（なお殺虫性タンパク質をコードしながらも）クローニングもしくは形質転換中にコーディングDNA内に導入された変化が原因で、いくつか、とりわけ1から10個のアミノ酸が別のアミノ酸により置き換えられたタンパク質、例えばワタイベントCOT102におけるVIP3Aaタンパク質など；または

9) バチルス・チューリンゲンシスからの結晶タンパク質の存在下で殺虫性である、バチルス・チューリンゲンシスもしくはバチルス・セレウスからの分泌タンパク質、例えばVIP3とCry1AもしくはCry1Fとから形成されるバイナリートキシン（米国特許出願第61/126083号および第61/195019号）、もしくはVIP3タンパク質とCry2AaもしくはCry2AbもしくはCry2Aeタンパク質とから形成されるバイナリートキシン（米国特許出願第12/214,022号およびEP08010791.5）など；または

10) 上記9)のタンパク質であって、標的昆虫種に対するより高い殺虫活性を得るために、および／もしくは作用する標的昆虫種の範囲を拡大するために、および／もしくは（なお殺虫性タンパク質をコードしながらも）クローニングもしくは形質転換中にコーディングDNA内に導入された変化が原因で、いくつか、とりわけ1から10個のアミノ酸が別のアミノ酸により置き換えられたタンパク質。

【0107】

もちろん、本明細書中で用いられる昆虫抵抗性遺伝子導入植物はまた、上記クラス1から10のうちのいずれか1のタンパク質をコードする遺伝子の組み合わせを含む任意の植物を包含する。1の実施形態において、昆虫抵抗性植物は、上記クラス1から10のうちのいずれか1のタンパク質をコードする1より多い導入遺伝子を含有するが、これは、同じ標的昆虫種に対して殺虫性であるが異なる作用様式、例えば昆虫内で異なる受容体結合部位に結合するなどの作用様式を持つ異なるタンパク質を用いることにより、異なる標的昆虫種に向けられた異なるタンパク質を用いた場合に作用する標的昆虫種の範囲を拡大するため、または植物に対する昆虫の抵抗性の発達を遅延させるためである。

【0108】

本明細書中で用いられる「昆虫抵抗性遺伝子導入植物」はさらに、例としてWO2007/080126、WO2006/129204、WO2007/074405、WO2007/080127およびWO2007/035650中に記載されているように、発現すると植物有害昆虫により摂取されたときにこの有害昆虫の成長を阻害する二本鎖RNAを生産する配列を含む少なくとも1の導入遺伝子を含有する任意の植物を包含する。

【0109】

本発明に従ってまた処理され得る植物または植物栽培品種（植物バイオテクノロジー法、例えば遺伝子操作などにより得られるもの）は、非生物学的ストレスに対して耐性である。かかる植物は、遺伝子形質転換により、またはかかるストレス抵抗性を付与する変異を含有する植物の選抜により得ることができる。とりわけ有用なストレス耐性植物としては、以下が挙げられる：

1) WO00/04173、WO/2006/045633、EP04077984.5またはEP06009836.5中に記載されているような、植物細胞または植物内でポリ(ADP-リボース)ポリメラーゼ(PARP)遺伝子の発現および／または活性を低減させる能力がある導入遺伝子を含有する植物。

【0110】

2) 例としてWO2004/090140中に記載されているような、植物または植物細胞のPARGをコードする遺伝子の発現および／または活性を低減させる能力があるストレス耐性増強性の導入遺伝子を含有する植物。

【0111】

3) 例としてEP04077624.7、WO2006/133827、PCT/EP07/002433、EP1999263またはWO2007/107326中に記載されているような、ニコチンアミダーゼ、ニコチネートホスホリボシルトランスフェラーゼ、ニコチン酸モノヌクレオチドアデニルトランスフェラーゼ、ニコチンアミドアデニンジヌ

クレオチドシンターゼまたはニコチンアミドホスホリボシルトランスフェラーゼを包含するニコチンアミドアデニンジヌクレオチドのサルベージ生合成経路の植物機能性酵素をコードするストレス耐性増強性の導入遺伝子を含む植物。

【0112】

本発明に従ってまた処理され得る植物または植物栽培品種（植物バイオテクノロジー法、例えば遺伝子操作などにより得られるもの）は、収穫生産物の量、品質および/もしくは保存安定性の変化ならびに/または収穫生産物の特定成分の性質の変化を示し、これらは例えば以下のものなどである：

1) その物理化学的特性、とりわけアミロース含量またはアミロース/アミロペクチン比、分岐度、平均鎖長、側鎖分布、粘度挙動、ゲル強度、デンプン粒の大きさおよび/またはデンプン粒の形態が野生型の植物細胞または植物において合成されたデンプンと比較して変化しており、そのために特別な用途により良く適している改質デンプンを合成する遺伝子導入植物。改質デンプンを合成する前記遺伝子導入植物は、例えば、EP0571427、WO95/04826、EP0719338、WO96/15248、WO96/19581、WO96/27674、WO97/11188、WO97/26362、WO97/32985、WO97/42328、WO97/44472、WO97/45545、WO98/27212、WO98/40503、WO99/58688、WO99/58690、WO99/58654、WO00/08184、WO00/08185、WO00/08175、WO00/28052、WO00/77229、WO01/12782、WO01/12826、WO02/101059、WO03/071860、WO2004/056999、WO2005/030942、WO2005/030941、WO2005/095632、WO2005/095617、WO2005/095619、WO2005/095618、WO2005/123927、WO2006/018319、WO2006/103107、WO2006/108702、WO2007/009823、WO00/22140、WO2006/063862、WO2006/072603、WO02/034923、EP06090134.5、EP06090228.5、EP06090227.7、EP07090007.1、EP07090009.7、WO01/14569、WO02/79410、WO03/33540、WO2004/078983、WO01/19975、WO95/26407、WO96/34968、WO98/20145、WO99/12950、WO99/66050、WO99/53072、US6,734,341、WO00/11192、WO98/22604、WO98/32326、WO01/98509、WO01/98509、WO2005/002359、US5,824,790、US6,013,861、WO94/04693、WO94/09144、WO94/11520、WO95/35026、WO97/20936、WO10/012796、WO10/003701中に記載されている。

【0113】

2) 非デンプン炭水化物ポリマーを合成する、または遺伝子改変を伴わない野生型植物と比較して性質が変化した非デンプン炭水化物ポリマーを合成する遺伝子導入植物。例は、ポリフルクトース、特に、EP0663956、WO96/01904、WO96/21023、WO98/39460およびWO99/24593中に記載されているようなイヌリンおよびレバン型のポリフルクトースを生産する植物、WO95/31553、US2002031826、US6,284,479、US5,712,107、WO97/47806、WO97/47807、WO97/47808およびWO00/14249中に記載されているようなアルファ-1,4-グルカンを生産する植物、WO00/73422中に記載されているようなアルファ-1,6分岐アルファ-1,4-グルカンを生産する植物、例としてWO00/47727、WO00/73422、EP06077301.7、US5,908,975およびEP0728213中に記載されているようなアルテルナンを生産する植物である。

【0114】

3) 例えばWO2006/032538、WO2007/039314、WO2007/

10

20

30

40

50

039315、WO2007/039316、JP2006304779およびWO2005/012529中に記載されているような、ヒアルロナンを生産する遺伝子導入植物。

【0115】

4) 米国特許出願第12/020,360号および第61/054,026号中に記載されているような、例えば「可溶性固形物が多い」「辛みが少ない」(LP)および/または「長期保存」(LS)などの特性を有するタマネギなどの遺伝子導入植物または雑種植物。

【0116】

5) 例えばWO11/095528中に記載されているような、収量増加を示す遺伝子導入植物。

10

【0117】

本発明に従ってまた処理され得る植物または植物栽培品種(植物バイオテクノロジー法、例えば遺伝子操作などにより得ることができるもの)は、繊維特性が変化した植物、例えばワタ植物などである。かかる植物は、遺伝子形質転換により、またはかかる繊維特性変化を付与する変異を含有する植物の選抜により得ることができ、以下が挙げられる:

a) WO98/00549中に記載されているような、変化形のセルロースシンターゼ遺伝子を含有する植物、例えばワタ植物など

b) WO2004/053219中に記載されているような、変化形のrsw2またはrsw3相同性核酸を含有する植物、例えばワタ植物など

20

c) WO01/17333中に記載されているような、スクロースホスフェートシンターゼの発現を増加させた植物、例えばワタ植物など;

d) WO02/45485中に記載されているような、スクロースシンターゼの発現を増加させた植物、例えばワタ植物など;

e) WO2005/017157中に記載されているような、またはEP08075514.3もしくは米国特許出願第61/128,938号中に記載されているような、例えば繊維選択的1,3-グルカナーゼのダウレギュレーションを通じて、繊維細胞の基底における原形質連絡ゲート開閉のタイミングが変化した植物、例えばワタ植物など;

f) WO2006/136351、WO11/089021、WO2012074868中に記載されているような、例えばnodCなどのN-アセチルグルコサミントランスフェラーゼ遺伝子およびキチンシンターゼ遺伝子の発現を通じて反応性が変化した繊維を持つ植物、例えばワタ植物など。

30

【0118】

本発明に従ってまた処理され得る植物または植物栽培品種(植物バイオテクノロジー法、例えば遺伝子操作などにより得ることができるもの)は、油プロファイル特性が変化した植物、例えばアブラナまたは近縁のブラシカ属(Brassica)植物などである。かかる植物は、遺伝子形質転換により、またはかかる油プロファイル特性変化を付与する変異を含有する植物の選抜により得ることができ、以下が挙げられる:

a) 例としてUS5,969,169、US5,840,946またはUS6,323,392またはUS6,063,947中に記載されているような、オレイン酸含量が高い油を生産する植物、例えばアブラナ植物など。

40

【0119】

b) US6,270,828、US6,169,190、US5,965,755またはWO11/060946中に記載されているような、リノレン酸含量が低い油を生産する植物、例えばアブラナ植物など。

【0120】

c) 例として米国特許第5,434,283号または米国特許出願第12/668303中に記載されているような、飽和脂肪酸レベルが低い油を生産する植物、例えばアブラナ植物など。

【0121】

50

d) WO 2012075426中に記載されているような、グルコシノレート含量が変化した (a l e t e r) 油を生産する植物、例えばアブラナ植物など。

【0122】

本発明に従ってまた処理され得る植物または植物栽培品種 (植物バイオテクノロジー法、例えば遺伝子操作などにより得ることができるもの) は、種子の脱粒特性が変化した植物、例えばアブラナまたは近縁のブラシカ属 (B r a s s i c a) 植物などである。かかる植物は、遺伝子形質転換により、またはかかる種子脱粒特性変化を付与する変異を含有する植物の選抜により得ることができ、米国特許出願第 61 / 135, 230号、WO 09 / 068313、WO 10 / 006732およびWO 2012090499中で記載されているような、種子脱粒が遅延または低減された植物、例えばアブラナ植物などが挙げられる。

10

【0123】

本発明に従ってまた処理され得る植物または植物栽培品種 (植物バイオテクノロジー法、例えば遺伝子操作などにより得ることができるもの) は、例えばWO 10 / 121818およびWO 10 / 145846中に記載されているような、翻訳後のタンパク質修飾パターンが変化した植物、例えばタバコ植物などである。

【0124】

本発明に従って処理され得るとりわけ有用な遺伝子導入植物は、米国内での規制除外について米国農務省 (U S D A) の動植物検疫所 (A P H I S) への申請の対象である形質転換イベントまたは形質転換イベントの組み合わせを含有する植物であり、かかる申請が許可されたか、なお継続中であるかは問わない。随時、この情報は、A P H I S (4700 River Road Riverdale, MD 20737, USA) から、例えばそのインターネットサイト (URL http://www.aphis.usda.gov/brs/not_reg.html) 上で容易に入手できる。本出願日において、A P H I S に係属していたまたはA P H I Sにより許可された規制除外の申請は、以下の情報を含有するものであった：

20

- 申請：申請の識別番号。形質転換イベントの技術的記載は、本申請番号を参照することにより例えばA P H I Sウェブサイト上でA P H I Sから入手可能である個々の申請書類中に見出すことができる。これらの記載は、参照により本明細書中に組み込まれる。

【0125】

30

- 申請の拡張：拡張が請求されている先の申請への参照。

【0126】

- 機関：申請を提出した事業体の名称。

【0127】

- 規制品：該当する植物種。

【0128】

- 遺伝子導入表現型：形質転換イベントにより植物に授けられた形質。

【0129】

- 形質転換イベントまたは系統：規制除外が請求されているイベント (複数可) (時に系統 (複数可) とも呼ばれる) の名称。

40

【0130】

- A P H I S 書類：申請に関してA P H I Sより発行された、およびA P H I Sに請求することができる様々な書類。

【0131】

単一の形質転換イベントまたは形質転換イベントの組み合わせを含有する、さらなるとりわけ有用な植物は、例えば様々な国または地域の規制当局からのデータベース中に収載されている (例えばhttp://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspxおよび<http://www.agbios.com/database.php>を参照されたい)。

【0132】

50

本発明に従って処理され得るとりわけ有用な遺伝子導入植物は、形質転換イベントまたは形質転換イベントの組み合わせを含有する植物であって、例えば様々な国または地域の規制当局のためのデータベース中に収載されており、これらとしては、イベント1143-14A(ワタ、昆虫防除、寄託されていない、WO2006/128569中に記載されている); イベント1143-51B(ワタ、昆虫防除、寄託されていない、WO2006/128570中に記載されている); イベント1445(ワタ、除草剤耐性、寄託されていない、US2002120964またはWO2002/034946中に記載されている); イベント17053(イネ、除草剤耐性、PTA-9843として寄託されている、WO2010/117737中に記載されている); イベント17314(イネ、除草剤耐性、PTA-9844として寄託されている、WO2010/117735中に記載されている); イベント281-24-236(ワタ、昆虫防除-除草剤耐性、PTA-6233として寄託されている、WO2005/103266またはUS2005216969中に記載されている); イベント3006-210-23(ワタ、昆虫防除-除草剤耐性、PTA-6233として寄託されている、US2007143876またはWO2005/103266中に記載されている); イベント3272(コーン、品質形質、PTA-9972として寄託されている、WO2006098952またはUS2006230473中に記載されている); イベント40416(コーン、昆虫防除-除草剤耐性、ATCC PTA-11508として寄託されている、WO2011/075593中に記載されている); イベント43A47(コーン、昆虫防除-除草剤耐性、ATCC PTA-11509として寄託されている、WO2011/075595中に記載されている); イベント5307(コーン、昆虫防除、ATCC PTA-9561として寄託されている、WO2010/077816中に記載されている); イベントASR-368(ペントグラス、除草剤耐性、ATCC PTA-4816として寄託されている、US2006162007またはWO2004053062中に記載されている); イベントB16(コーン、除草剤耐性、寄託されていない、US2003126634中に記載されている); イベントBPS-CV127-9(ダイズ、除草剤耐性、NCIMB No. 41603として寄託されている、WO2010/080829中に記載されている); イベントCE43-67B(ワタ、昆虫防除、DSM ACC2724として寄託されている、US2009217423またはWO2006/128573中に記載されている); イベントCE44-69D(ワタ、昆虫防除、寄託されていない、US20100024077中に記載されている); イベントCE44-69D(ワタ、昆虫防除、寄託されていない、WO2006/128571中に記載されている); イベントCE46-02A(ワタ、昆虫防除、寄託されていない、WO2006/128572中に記載されている); イベントCOT102(ワタ、昆虫防除、寄託されていない、US2006130175またはWO2004039986中に記載されている); イベントCOT202(ワタ、昆虫防除、寄託されていない、US2007067868またはWO2005054479中に記載されている); イベントCOT203(ワタ、昆虫防除、寄託されていない、WO2005/054480中に記載されている); イベントDAS40278(コーン、除草剤耐性、ATCC PTA-10244として寄託されている、WO2011/022469中に記載されている); イベントDAS-59122-7(コーン、昆虫防除-除草剤耐性、ATCC PTA 11384として寄託されている、US2006070139中に記載されている); イベントDAS-59132(コーン、昆虫防除-除草剤耐性、寄託されていない、WO2009/100188中に記載されている); イベントDAS68416(ダイズ、除草剤耐性、ATCC PTA-10442として寄託されている、WO2011/066384またはWO2011/066360中に記載されている); イベントDP-098140-6(コーン、除草剤耐性、ATCC PTA-8296として寄託されている、US2009137395またはWO2008/112019中に記載されている); イベントDP-305423-1(ダイズ、品質形質、寄託されていない、US2008312082またはWO2008/054747中に記載されている); イベントDP-32138-1(コーン、交雑系、

10

20

30

40

50

ATCC PTA - 9158として寄託されている、US20090210970または
 WO2009/103049中に記載されている) ; イベントDP - 356043 - 5 (
 ダイズ、除草剤耐性、ATCC PTA - 8287として寄託されている、US2010
 0184079またはWO2008/002872中に記載されている) ; イベントEE
 - 1 (ブリンジャル (brinj al)、昆虫防除、寄託されていない、WO2007/
 091277中に記載されている) ; イベントFI117 (コーン、除草剤耐性、ATC
 C 209031として寄託されている、US2006059581またはWO1998
 /044140中に記載されている) ; イベントGA21 (コーン、除草剤耐性、ATC
 C 209033として寄託されている、US2005086719またはWO1998
 /044140中に記載されている) ; イベントGG25 (コーン、除草剤耐性、ATC
 C 209032として寄託されている、US2005188434またはWO1998
 /044140中に記載されている) ; イベントGHB119 (ワタ、昆虫防除 - 除草剤
 耐性、ATCC PTA - 8398として寄託されている、WO2008/151780
 中に記載されている) ; イベントGHB614 (ワタ、除草剤耐性、ATCC PTA -
 6878として寄託されている、US2010050282またはWO2007/017
 186中に記載されている) ; イベントGJ11 (コーン、除草剤耐性、ATCC 20
 9030として寄託されている、US2005188434またはWO1998/044
 140中に記載されている) ; イベントGM RZ13 (テンサイ、ウイルス抵抗性、N
 CIMB - 41601として寄託されている、WO2010/076212中に記載され
 ている) ; イベントH7 - 1 (テンサイ、除草剤耐性、NCIMB 41158またはN
 CIMB 41159として寄託されている、US2004172669またはWO20
 04/074492中に記載されている) ; イベントJOPLIN1 (コムギ、病害耐性
 、寄託されていない、US2008064032中に記載されている) ; イベントLL2
 7 (ダイズ、除草剤耐性、NCIMB41658として寄託されている、WO2006/
 108674またはUS2008320616中に記載されている) ; イベントLL55
 (ダイズ、除草剤耐性、NCIMB 41660として寄託されている、WO2006/
 108675またはUS2008196127中に記載されている) ; イベントLLco
 tton25 (ワタ、除草剤耐性、ATCC PTA - 3343として寄託されている、
 WO2003013224またはUS2003097687中に記載されている) ; イベ
 ントLLRICE06 (イネ、除草剤耐性、ATCC - 23352として寄託されている
 、US6468747またはWO2000/026345中に記載されている) ; イベ
 ントLLRICE601 (イネ、除草剤耐性、ATCC PTA - 2600として寄託され
 ている、US20082289060またはWO2000/026356中に記載されて
 いる) ; イベントLY038 (コーン、品質形質、ATCC PTA - 5623として寄
 託されている、US2007028322またはWO2005061720中に記載され
 ている) ; イベントMIR162 (コーン、昆虫防除、PTA - 8166として寄託され
 ている、US2009300784またはWO2007/142840中に記載されてい
 る) ; イベントMIR604 (コーン、昆虫防除、寄託されていない、US200816
 7456またはWO2005103301中に記載されている) ; イベントMON159
 85 (ワタ、昆虫防除、ATCC PTA - 2516として寄託されている、US200
 4 - 250317またはWO2002/100163中に記載されている) ; イベントM
 ON810 (コーン、昆虫防除、寄託されていない、US2002102582中に記載
 されている) ; イベントMON863 (コーン、昆虫防除、ATCC PTA - 2605
 として寄託されている、WO2004/011601またはUS2006095986中
 に記載されている) ; イベントMON87427 (コーン、受粉制御、ATCC PTA
 - 7899として寄託されている、WO2011/062904中に記載されている) ;
 イベントMON87460 (コーン、ストレス耐性、ATCC PTA - 8910として
 寄託されている、WO2009/111263またはUS20110138504中に記
 載されている) ; イベントMON87701 (ダイズ、昆虫防除、ATCC PTA - 8
 194として寄託されている、US2009130071またはWO2009/0646

10

20

30

40

50

52中に記載されている) ; イベントMON87705 (ダイズ、品質形質 - 除草剤耐性、ATCC PTA - 9241として寄託されている、US20100080887またはWO2010/037016中に記載されている) ; イベントMON87708 (ダイズ、除草剤耐性、ATCC PTA9670として寄託されている、WO2011/034704中に記載されている) ; イベントMON87754 (ダイズ、品質形質、ATCC PTA - 9385として寄託されている、WO2010/024976中に記載されている) ; イベントMON87769 (ダイズ、品質形質、ATCC PTA - 8911として寄託されている、US20110067141またはWO2009/102873中に記載されている) ; イベントMON88017 (コーン、昆虫防除 - 除草剤耐性、ATCC PTA - 5582として寄託されている、US2008028482またはWO2005/059103中に記載されている) ; イベントMON88913 (ワタ、除草剤耐性、ATCC PTA - 4854として寄託されている、WO2004/072235またはUS2006059590中に記載されている) ; イベントMON89034 (コーン、昆虫防除、ATCC PTA - 7455として寄託されている、WO2007/140256またはUS2008260932中に記載されている) ; イベントMON89788 (ダイズ、除草剤耐性、ATCC PTA - 6708として寄託されている、US2006282915またはWO2006/130436中に記載されている) ; イベントMS11 (アブラナ、受粉制御 - 除草剤耐性、ATCC PTA - 850またはPTA - 2485として寄託されている、WO2001/031042中に記載されている) ; イベントMS8、(アブラナ、受粉制御 - 除草剤耐性、ATCC PTA - 730として寄託されている、WO2001/041558またはUS2003188347中に記載されている) ; イベントNK603 (コーン、除草剤耐性、ATCC PTA - 2478として寄託されている、US2007-292854中に記載されている) ; イベントPE-7 (イネ、昆虫防除、寄託されていない、WO2008/114282中に記載されている) ; イベントRF3、(アブラナ、受粉制御 - 除草剤耐性、ATCC PTA - 730として寄託されている、WO2001/041558またはUS2003188347中に記載されている) ; イベントRT73 (アブラナ、除草剤耐性、寄託されていない、WO2002/036831またはUS2008070260中に記載されている) ;

イベントT227-1 (テンサイ、除草剤耐性、寄託されていない、WO2002/44407またはUS2009265817中に記載されている) ; イベントT25 (コーン、除草剤耐性、寄託されていない、US2001029014またはWO2001/051654中に記載されている) ; イベントT304-40 (ワタ、昆虫防除 - 除草剤耐性、ATCC PTA - 8171として寄託されている、US2010077501またはWO2008/122406中に記載されている) ; イベントT342-142 (ワタ、昆虫防除、寄託されていない、WO2006/128568中に記載されている) ; イベントTC1507 (コーン、昆虫防除 - 除草剤耐性、寄託されていない、US2005039226またはWO2004/099447中に記載されている) ; イベントVIP1034 (コーン、昆虫防除 - 除草剤耐性、ATCC PTA - 3925として寄託されている、WO2003/052073中に記載されている) ; イベント32316 (コーン、昆虫防除 - 除草剤耐性、PTA - 11507として寄託されている、WO2011/153186A1中に記載されている) ; イベント4114 (コーン、昆虫防除 - 除草剤耐性、PTA - 11506として寄託されている、WO2011/084621中に記載されている) ; イベントEE-GM3/FG72 (ダイズ、除草剤耐性、ATCCアクセッションN° PTA - 11041、WO2011/063413A2) ; イベントDAS-68416-4 (ダイズ、除草剤耐性、ATCCアクセッションN° PTA - 10442、WO2011/066360A1) ; イベントDAS-68416-4 (ダイズ、除草剤耐性、ATCCアクセッションN° PTA - 10442、WO2011/066384A1) ; イベントDP-040416-8 (コーン、昆虫防除、ATCCアクセッションN° PTA - 11508、WO2011/075593A1) ; イベントDP-

10

20

30

40

50

043A47-3(コーン、昆虫防除、ATCCアクセッションN° PTA-11509、WO2011/075595A1)、イベントDP-004114-3(コーン、昆虫防除、ATCCアクセッションN° PTA-11506、WO2011/084621A1)、イベントDP-032316-8(コーン、昆虫防除、ATCCアクセッションN° PTA-11507、WO2011/084632A1)、イベントMON-88302-9(アブラナ、除草剤耐性、ATCCアクセッションN° PTA-10955、WO2011/153186A1)、イベントDAS-21606-3(ダイズ、除草剤耐性、ATCCアクセッションNo. PTA-11028、WO2012/033794A2)、イベントMON-87712-4(ダイズ、品質形質、ATCCアクセッションN° PTA-10296、WO2012/051199A2)、イベントDAS-44406-6(ダイズ、除草剤耐性の積み重ね、ATCCアクセッションN° PTA-11336、WO2012/075426A1)、イベントDAS-14536-7(ダイズ、除草剤耐性の積み重ね、ATCCアクセッションN° PTA-11335、WO2012/075429A1)、イベントSYN-000H2-5(ダイズ、除草剤耐性、ATCCアクセッションN° PTA-11226、WO2012/082548A2)、イベントDP-061061-7(アブラナ、除草剤耐性、入手可能な寄託N°はない、WO2012071039A1)、イベントDP-073496-4(アブラナ、除草剤耐性、入手可能な寄託N°はない、US2012131692)、イベント8264.44.06.1(ダイズ、除草剤耐性の積み重ね、アクセッションN° PTA-11336、WO2012075426A2)、イベント8291.45.36.2(ダイズ、除草剤耐性の積み重ね、アクセッションN° PTA-11335、WO2012075429A2)が挙げられる。

10

20

【0133】

材料保護において、本発明の物質は、望ましくない真菌および/または微生物による感染および破壊からの工業材料の保護のために、用いられ得る。

【0134】

工業材料は、本発明との関連で、工学における使用のために調製された非生物材料と理解される。例えば、本発明の活性材料により微生物学的変化または破壊から保護される対象である工業材料は、粘着剤、接着剤、紙およびボール紙、織物、カーペット、皮革、木材、塗料およびプラスチック製品、冷却潤滑剤および微生物が感染または破壊することができる他の材料であることができる。保護対象の材料の関連の中にあるものはまた、真菌および/または微生物の繁殖により悪影響を受けることがある生産プラントおよび建物の一部、例えば冷却回路、冷却および加熱システム、空調および換気システムである。本発明の関連の中にあるもの、好ましくは工業材料として言及されるものは、粘着剤、接着剤、紙およびボール紙、皮革、木材、塗料、冷却潤滑剤および熱交換液であり、とりわけ好ましくは木材である。本発明による組み合わせは、不利益な作用、例えば腐食、変色および脱色またはカビの生成などを防ぐことができる。本発明による活性化化合物の組み合わせおよび組成物は同じく、海水または汽水と接触する物体、とりわけ船体、篩、網、建造物、岸壁および信号設備を腐生から保護するために使用することができる。

30

【0135】

本発明による処理方法はまた、真菌および微生物の攻撃から保存品を保護する分野において用いることもできる。本発明によると、用語「保存品」は、自然の生活環から採取され、長期の保護が望まれる植物または動物起源の天然物質およびそれらの加工形態を意味するものと理解される。植物起源の保存品、例えば植物またはその部分、例えば柄、葉、塊茎、種子、果実または穀物などは、収穫したての状態で、または加工された形態で、例えば(予備)乾燥、湿潤、細砕、粉碎、圧搾もしくは焙煎された形態などで保護することができる。また保存品の定義の下に入るのは材木であり、加工されていない材木の形態、例えば建築材木、送電塔および柵などであるか、または完成品の形態、例えば家具もしくは木材から作られる物体などであるかを問わない。動物起源の保存品は、獣皮、皮革、毛皮、毛髪などである。本発明による組み合わせは、不利益な作用、例えば腐食、変色また

40

50

はカビの生成などを防ぐことができる。好ましくは、「保存品」は、植物起源の天然物質およびその加工形態を、より好ましくは果実およびその加工形態、例えば仁果、核果、小軟果および柑橘類果実ならびにそれらの加工形態などを意味するものと理解される。

【0136】

本発明に従って処理することができる真菌病のいくつかの病原体が例として言及され得るが、限定としてのものではない：

ウドンコ病病原体に起因する病害、例えば、ブルメリア属種 (*Blumeria species*)、例えばブルメリア・グラミニス (*Blumeria graminis*) など；ポドスファエラ属種 (*Podosphaera species*)、例えばポドスファエラ・ロイコトリカ (*Podosphaera leucotricha*) など；スファエロテカ属種 (*Sphaerotheca species*)、例えばスファエロテカ・フリギネア (*Sphaerotheca fuliginea*) など；ウンシヌラ属種 (*Uncinula species*)、例えばウンシヌラ・ネカトル (*Uncinula necator*) などに起因するもの；

サビ病病原体に起因する病害、例えば、ギムノスポランギウム属種 (*Gymnosporangium species*)、例えばギムノスポランギウム・サビナエ (*Gymnosporangium sabinae*) など；ヘミレイア属種 (*Hemileia species*)、例えばヘミレイア・バスタトリクス (*Hemileia vastatrix*) など；ファコプソラ属種 (*Phakopsora species*)、例えばファコプソラ・パキリジ (*Phakopsora pachyrhizi*) およびファコプソラ・メイボミアエ (*Phakopsora meibomiaae*) など；プッシニア属種 (*Puccinia species*)、例えばプッシニア・レコンジタ (*Puccinia recondita*) またはプッシニア・トリチシナ (*Puccinia trititcina*) など；ウロミセス属種 (*Uromyces species*)、例えばウロミセス・アペンジクラタス (*Uromyces appendiculatus*) などに起因するもの；

卵菌類 (*Oomycetes*) の群からの病原体に起因する病害、例えば、ブレミア属種 (*Bremia species*)、例えばブレミア・ラクツカエ (*Bremia lactucae*) など；ペロノスポラ属種 (*Peronospora species*)、例えばペロノスポラ・ピシ (*Peronospora pisi*) または *P. brassicae* など；フィトフトラ属種 (*Phytophthora species*)、例えばフィトフトラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*) など；プラスモパラ属種 (*Plasmopara species*)、例えばプラスモパラ・ビチコラ (*Plasmopara viticola*) など；シュードペロノスポラ属種 (*Pseudoperonospora species*)、例えばシュードペロノスポラ・フムリ (*Pseudoperonospora humuli*) またはシュードペロノスポラ・キュベンシス (*Pseudoperonospora cubensis*) など；フィチウム属種 (*Pythium species*)、例えばフィチウム・ウルチマム (*Pythium ultimum*) などに起因するもの；

葉の汚斑病 (*blotch disease*) および葉の萎凋病 (*wilt disease*)、例えば、アルテルナリア属種 (*Alternaria species*)、例えばアルテルナリア・ソラニ (*Alternaria solani*) など；セルコスボラ属種 (*Cercospora species*)、例えばセルコスボラ・ベチコラ (*Cercospora beticola*) など；クラジオスポリウム属種 (*Cladospodium species*)、例えばクラジオスポリウム・ククメリナム (*Cladospodium cucumerinum*) など；コクリオボルス属種 (*Cochliobolus species*)、例えばコクリオボルス・サチバス (*Cochliobolus sativus*) (分生子形態：ドレクスレラ (*Drechslera*), *Syn.* : ヘルミントスポリウム (*Helminthosporium*)) など；コレトトリカム属種 (*Colletotrichum species*)、例えばコレトトリカ

10

20

30

40

50

ム・リンデムタニウム (*Colletotrichum lindemuthanium*) など; シクロコニウム属種 (*Cycloconium species*)、例えばシクロコニウム・オレアギナム (*Cycloconium oleaginum*) など; ジアポルテ属種 (*Diaporthe species*)、例えばジアポルテ・シトリ (*Diaporthe citri*) など; エルシノエ属種 (*Elsinoe species*)、例えばエルシノエ・ファウセッティ (*Elsinoe fawcettii*) など; グロエオスポリウム属種 (*Gloeosporium species*)、例えばグロエオスポリウム・ラエチコロール (*Gloeosporium laeticolor*) など; グロメラ属種 (*Glomerella species*)、例えばグロメラ・シングラタ (*Glomerella cingulata*) など; ギナーディア属種 (*Guignardia species*)、例えばギナーディア・ビドウェリ (*Guignardia bidwelli*) など; レプトスフェリア属種 (*Leptosphaeria species*)、例えばレプトスフェリア・マクランス (*Leptosphaeria maculans*) およびレプトスフェリア・ノドラム (*Leptosphaeria nodorum*) など; マグナポルテ属種 (*Magnaporthe species*)、例えばマグナポルテ・グリセア (*Magnaporthe grisea*) など; ミクロドキウム属種 (*Microdochium species*)、例えばミクロドキウム・ニバレ (*Microdochium nivale*) など; ミコスファエレラ属種 (*Mycosphaerella species*)、例えばミコスファエレラ・グラミニコラ (*Mycosphaerella graminicola*)、ミコスファエレラ・アラキジコラ (*Mycosphaerella arachidicola*) およびミコスファエレラ・フィジエンシス (*Mycosphaerella fijiensis*) など; ファエオスファエリア属種 (*Phaeosphaeria species*)、例えばファエオスファエリア・ノドラム (*Phaeosphaeria nodorum*) など; ピレノフォラ属種 (*Pyrenophora species*)、例えばピレノフォラ・テレス (*Pyrenophora teres*) など; ラムラリア属種 (*Ramularia species*)、例えばラムラリア・コロ・シグニ (*Ramularia collo-cygni*) など; リンコスポリウム属種 (*Rhynchosporium species*)、例えばリンコスポリウム・セカリス (*Rhynchosporium secalis*) など; セプトリア属種 (*Septoria species*)、例えばセプトリア・アピイ (*Septoria apii*) およびセプトリア・リコペルシ (*Septoria lycopersici*) など; チフラ属種 (*Typhula species*)、例えばチフラ・インカルナタ (*Typhula incarnata*) など; ベンツリア属種 (*Venturia species*)、例えばベンツリア・イナエクアリス (*Venturia inaequalis*) などに起因するもの; 根および茎の病害、例えば、コルチシウム属種 (*Corticium species*)、例えばコルチシウム・グラミネアルム (*Corticium graminearum*) など; フザリウム属種 (*Fusarium species*)、例えばフザリウム・オキシスポルム (*Fusarium oxysporum*) など; ゴウマノマイセス属種 (*Gaeumannomyces species*)、例えばゴウマノマイセス・グラミニス (*Gaeumannomyces graminis*) など; リゾクトニア属種 (*Rhizoctonia species*)、例えばリゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) など; タペシア属種 (*Tapesia species*)、例えばタペシア・アクホルミス (*Tapesia acuformis*) など; チエラビオプシス属種 (*Thielaviopsis species*)、例えばチエラビオプシス・バシコラ (*Thielaviopsis basicola*) などに起因するもの; 穂 (Ear and panicle) (トウモロコシ穂軸を包含する) の病害、例えば、アルテルナリア属種 (*Alternaria species*)、例えばアルテルナリア属種 (*Alternaria spp.*) など; アスペルギルス属種 (*Aspergillus species*)、例えばアスペルギルス・フラブス (*Aspergillus*

10

20

30

40

50

s flavus) など; クラドスポリウム属種 (Cladosporium species)、例えばクラドスポリウム・クラドスポリオイデス (Cladosporium cladosporioides) など; クラビセプス属種 (Claviceps species)、例えばクラビセプス・プルプレア (Claviceps purpurea) など; フザリウム属種、例えばフザリウム・クルモラム (Fusarium culmorum) など; ジベレラ属種 (Gibberella species)、例えばジベレラ・ゼアエ (Gibberella zeae) など; モノグラフェラ属種 (Monographella species)、例えばモノグラフェラ・ニバリス (Monographella nivalis) など; セプトリア属種、例えばセプトリア・ノドラム (Septoria nodorum) など; 10

種子および土壌が媒介する腐食、カビ、萎凋、腐敗および立枯病 (damping-off disease)、例えば、アルテルナリア病 (Alternaria disease)、例えばアルテルナリア・ブラシシコラ (Alternaria brassicicola) に起因するもの; アファノミセス病 (Aphanomyces disease)、例えばアファノミセス・エウテイケス (Aphanomyces euteiches) に起因するもの; アスコキタ病 (Ascochyta disease)、例えばアスコキタ・レンチス (Ascochyta lentis) に起因するもの; アスペルギルス病 (Aspergillus disease)、例えばアスペルギルス・フラブスに起因するもの; クラドスポリウム病 (Cladosporium disease)、例えばクラドスポリウム・ヘルバラム (Cladosporium herbarum) に起因するもの; コクリオボルス病 (Cochliobolus disease)、例えばコクリオボルス・サチパス; (分生子形態: ドレクスレラ、ビポラリス (Bipolaris) Syn: ヘルミントスポリウム) に起因するもの; コレトトリカム病 (Colletotrichum disease)、例えばコレトトリカム・コッコデス (Colletotrichum coccodes) に起因するもの; フザリウム病 (Fusarium disease)、例えばフザリウム・クルモラムに起因するもの; ジベレラ病 (Gibberella disease)、例えばジベレラ・ゼアエに起因するもの; マクロフォミナ病 (Macrophomina disease)、例えばマクロフォミナ・ファゼオリナ (Macrophomina phaseolina) に起因するもの; ミクロドキウム病 (Microdochium disease)、例えば 30
ミクロドキウム・ニバレに起因するもの; モノグラフェラ病 (Monographella disease)、例えばモノグラフェラ・ニバリスに起因するもの; ペニシリウム病 (Penicillium disease)、例えばペニシリウム・エキспанサム (Penicillium expansum) に起因するもの; フォーマ病 (Phoma disease)、例えばフォーマ・リンガム (Phoma lingam) に起因するもの; フォモプシス病 (Phomopsis disease)、例えばフォモプシス・ソジャエ (Phomopsis sojae) に起因するもの; フィトフトラ病 (Phytophthora disease)、例えばフィトフトラ・カクトラム (Phytophthora cactorum) に起因するもの; ピレノフォラ病 (Pyrenophora disease)、例えばピレノフォラ・グラミネア (Pyrenophora graminea) に起因するもの; ピリクラリア病 (Pyricularia disease)、例えばピリクラリア・オリゼ (Pyricularia oryzae) に起因するもの; フィチウム病 (Pythium disease)、例えばフィチウム・ウルチマムに起因するもの; リゾクトニア病 (Rhizoctonia disease)、例えばリゾクトニア・ソラニに起因するもの; リゾプス病 (Rhizopus disease)、例えばリゾプス・オリゼ (Rhizopus oryzae) に起因するもの; スクレロチウム病 (Sclerotium disease)、例えばスクレロチウム・ロルフシイ (Sclerotium rolfsii) に起因するもの; セプトリア病 (Septoria disease)、例えばセプトリア・ノドラムに起因するもの; チフラ病 (Typhula disease)、例えばチフラ・インカルナ 50

タに起因するもの；ベルチシリウム病 (*Verticillium disease*)、例えばベルチシリウム・ダーリアエに起因するもの；

黒穂菌類 (*smut and bunt fungi*) に起因する病害、例えばスファセロテカ属種 (*Sphacelotheca species*)、例えばスファセロテカ・レイリアナ (*Sphacelotheca reiliana*) など；チレチア属種 (*Tilletia species*)、例えばチレチア・カリエス (*Tilletia caries*)；*T. コントロベルサ* (*T. controversa*) など；ウロシスチス属種 (*Urocystis species*)、例えばウロシスチス・オクルタ (*Urocystis occulta*) など；ウスチラゴ属種 (*Ustilago species*)、例えばウスチラゴ・ヌダ (*Ustilago nuda*)；*U. ヌダ・トリチシ* (*U. nuda tritici*) などに起因するもの；

10

果実の腐朽、例えば、アスペルギルス属種、例えばアスペルギルス・フラブスなど；ボトリチス属種 (*Botrytis species*)、例えばボトリチス・シネレア (*Botrytis cinerea*) など；ペニシリウム属種 (*Penicillium species*)、例えばペニシリウム・エキスパンサムおよび *P. プルプロゲナム* (*P. purpurogenum*) など；スクレロチニア属種 (*Sclerotinia species*)、例えばスクレロチニア・スクレロチオラム (*Sclerotinia sclerotiorum*) など；ベルチシリウム属種 (*Verticillium species*)、例えばベルチシリウム・アルボアトラム (*Verticillium albo-atrum*) などに起因するもの；

20

種子および土壌が媒介する腐朽および萎凋病、ならびにまた苗の病害、例えば、フザリウム属種、例えばフザリウム・クルモラムなど；フィトフトラ属種、例えばフィトフトラ・カクトラムなど；フィチウム属種、例えばフィチウム・ウルチマムなど；リゾクトニア属種、例えばリゾクトニア・ソラニなど；スクレロチウム属種 (*Sclerotium species*)、例えばスクレロチウム・ロルフシイなどに起因するもの；

がん腫病、虫こぶおよび天狗巣病 (*witches' broom*)、例えば、ネクトリア属種 (*Nectria species*)、例えばネクトリア・ガリゲナ (*Nectria galligena*) などに起因するもの；

萎凋病、例えば、モニリニア属種 (*Monilinia species*)、例えばモニリニア・ラキサ (*Monilinia laxa*) などに起因するもの；

30

葉、花および果実の奇形、例えば、タフリナ属種 (*Taphrina species*)、例えばタフリナ・デフォルマンズ (*Taphrina deformans*) などに起因するもの；

木本植物の変性病害、例えば、エスカ属種 (*Esca species*)、例えばファエモニエラ・クラミドスポラ (*Phaemoniella clamydospora*) およびファエオアクレモニウム・アレオフィラム (*Phaeoacremonium aleophilum*) およびフォミチポリア・メジテラネア (*Fomitiporia mediterranea*) などに起因するもの；

花および種子の病害、例えば、ボトリチス属種、例えばボトリチス・シネレアに起因するもの；

40

植物塊茎の病害、例えば、リゾクトニア属種、例えばリゾクトニア・ソラニなど；ヘルミントスポリウム属種 (*Helminthosporium species*)、例えばヘルミントスポリウム・ソラニ (*Helminthosporium solani*) などに起因するもの；

細菌性病原体に起因する病害、例えばキサントモナス属種 (*Xanthomonas species*)、例えばキサントモナス・カムペストリス病原型オリゼ (*Xanthomonas campestris pv. oryzae*) など；シュードモナス属種 (*Pseudomonas species*)、例えばシュードモナス・シリンガエ病原型ラクリマンズ (*Pseudomonas syringae pv. lachrymans*) など；エルウィニア属種 (*Erwinia species*)、例えばエルウィニア・

50

アミロボラ (*Erwinia amylovora*) などに起因するもの。

【0137】

好ましいのは、ダイズの以下の病害を防除することである：

葉、茎、さやおよび種子の真菌病、例えば、アルテルナリア斑点病 (*alternaria leaf spot*) (アルテルナリア属種アトランス・テヌイシマ (*alternaria spec. atrans tenuissima*))、炭疽病 (コレトリカム・グロエオスポロイデス・デマティウム変種トランケイタム (*Colletotrichum gloeosporoides dematium var. truncatum*))、褐斑症 (*brown spot*) (セプトリア・グリシネス (*Septoria glycines*))、セルコスボラ斑点病および胴枯病 (*cercospora leaf spot and blight*) (セルコスボラ・キクチイ (*Cercospora kikuchii*))、コアネフォラ葉枯病 (*choanephora leaf blight*) (コアネフォラ・インフンジブリフェラ・トリスボラ (*Choanephora infundibulifera trispora*) (Syn.))、ダクツリオホラ斑点病 (*dactuliophora leaf spot*) (ダクツリオホラ・グリシネス (*Dactuliophora glycines*))、べと病 (*downy mildew*) (ペロノスポラ・マンシュリカ (*Peronospora manshurica*))、ドレクスレラ葉枯病 (*drechslera blight*) (ドレクスレラ・グリシニ (*Drechslera glycini*))、フロッグアイ斑点病 (*frogeye leaf spot*) (セルコスボラ・ソジナ (*Cercospora sojae*))、レプトスファエルリナ斑点病 (*leptosphaerulina leaf spot*) (レプトスファエルリナ・トリホリイ (*Leptosphaerulina trifolii*))、フィロスティカ斑点病 (*phyllosticta leaf spot*) (フィロスティカ・ソジャエコラ (*Phyllosticta sojaecola*))、さやおよび茎枯病 (*pod and stem blight*) (フォモプシス・ソジャエ)、ウドンコ病 (ミクロスファエラ・ジフーサ (*Microsphaera diffusa*))、ピレノカエタ斑点病 (*pyrenochaeta leaf spot*) (ピレノカエタ・グリシネス (*Pyrenochaeta glycines*))、リゾクトニア葉腐、葉枯およびくもの巣病 (*rhizoctonia aerial, foliage, and web blight*) (リゾクトニア・ソラニ)、サビ病 (ファコプソラ・パキリジ、ファコプソラ・メイボミアエ)、黒痘病 (*scab*) (スファセロマ・グリシネス (*Sphaceloma glycines*))、ステムフィリウム葉枯病 (*stemphylium leaf blight*) ((ステムフィリウム・ボトリオサム (*Stemphylium botryosum*))、輪紋病 (*target spot*) (コリネスボラ・カッシイコラ (*Corynespora cassiicola*)) に起因するもの。

【0138】

根および茎基部の真菌病、例えば、黒色根腐病 (*black root rot*) (カロネクトリア・クロタラリアエ (*Calonectria crotalariae*))、炭腐病 (*charcoal rot*) (マクロフォミナ・ファゼオリナ)、赤かび病またはフザリウム萎凋、根腐ならびにさやおよび地際部腐病 (*fusarium blight or wilt, root rot, and pod and collar rot*) (フザリウム・オキシスポルム、フザリウム・オルトセラス (*Fusarium orthoceras*))、フザリウム・セミテクタム (*Fusarium semitectum*)、フザリウム・エキセイチ (*Fusarium equiseti*))、ミコレプトディスカス根腐病 (*mycoleptodiscus root rot*) (ミコレプトディスカス・テレストリス (*Mycoleptodiscus terrestris*))、ネオコスモスポラ (*neocosmospora*) (ネオコスモスポラ・バシンフェクタ (*Neocosmospora vasinfecta*))、さやおよび茎枯病 (*pod and stem blight*) (ジアボルテ・ファセオロラム (*Diapo*

10

20

30

40

50

r the phaseolorum))、茎潰瘍 (stem canker) (ジアボル
 テ・ファセオロラム変種コーリボラ (Diaporthe phaseolorum v
 ar. caulivora))、フィトフトラ腐敗病 (phytophthora ro
 t) (フィトフトラ・メガスペルマ (Phytophthora megasperma
))、落葉病 (brown stem rot) (フィアロホラ・グレガタ (Phial
 ophora gregata))、フィチウム腐敗病 (pythium rot) (フ
 イチウム・アフアニデルマタム (Pythium aphanidermatum)、フ
 イチウム・イレグラレ (Pythium irregulare)、フィチウム・デバリ
 アヌム (Pythium debaryanum)、フィチウム・ミリオチルム (Pyt
 hium myriotylum)、フィチウム・ウルチマム)、リゾクトニア根腐病、
 茎腐病および立枯病 (rhizoctonia root rot, stem deca
 y, and damping-off) (リゾクトニア・ソラニ)、スクレロチニア茎腐
 病 (sclerotinia stem decay) (スクレロチニア・スクレロチオ
 ラム)、スクレロチニア白絹病 (sclerotinia Southern blig
 ht) (スクレロチニア・ロルフシ (Sclerotinia rolfsii))、チ
 エラビオプシス根腐病 (Thielaviopsis root rot) (チエラビオ
 プシス・バシコラ) に起因するもの。

【0139】

上で言及された生物の抵抗性株を防除することもまた可能である。

【0140】

言及され得る工業用材料を分解または変化させる能力がある微生物は、例えば、細菌、
 真菌、酵母、藻類および粘液生物である。本発明による活性化合物は、好ましくは、真菌
 、とりわけカビ、木材変色性および木材破壊性真菌 (担子菌類 (Basidiomycetes)) に対して、ならびに粘液生物および藻類に対して作用する。以下の属の微生物
 が例として言及され得る：アルテルナリア属、例えばアルテルナリア・テヌイス (Alt
 ernaria tenuis) など、アスペルギルス属、例えばアスペルギルス・ニガ
 ー (Aspergillus niger) など、ケトミウム属 (Chaetomium
)、例えばケトミウム・グロボサム (Chaetomium globosum) など、
 コニオフォラ属 (Coniophora)、例えばコニオフォラ・プエタナ (Conio
 phora puetana) など、レンチヌス属 (Lentinus)、例えばレンチ
 ヌス・チグリナス (Lentinus tigrinus) など、ペニシリウム属 (Pe
 nicillium)、例えばペニシリウム・グラウカム (Penicillium gla
 ucum) など、ポリポラス属 (Polyporus)、例えばポリポラス・ベルシ
 カラー (Polyporus versicolor) など、アウレオバシジウム属 (A
 ureobasidium)、例えばアウレオバシジウム・プルランス (Aureoba
 sidium pullulans) など、スクレロフォマ属 (Sclerophoma
)、例えばスクレロフォマ・ピチオフィラ (Sclerophoma pityophi
 la) など、トリコデルマ属 (Trichoderma)、例えばトリコデルマ・ビリデ
 (Trichoderma viride) など、エシェリキア属 (Escherich
 ia)、例えばエシェリキア・コリ (Escherichia coli) など、シュー
 ドモナス属 (Pseudomonas)、例えばシュードモナス・エルギノーサ (Pse
 udomonas aeruginosa) など、およびスタフィロコッカス属 (Sta
 phylococcus)、例えばスタフィロコッカス・アウレウス (Staphylo
 coccus aureus) など。

【0141】

加えて、本発明による式 (I) の化合物はまた、非常に良好な抗真菌活性を持つ。それ
 らは、とりわけ皮膚糸状菌および酵母、カビおよび二相性真菌に対して (例えばカンジダ
 属種 (Candida species)、例えばカンジダ・アルビカンス (Candi
 da albicans)、カンジダ・グラブラタ (Candida glabrata
) などに対して)、ならびにエピデルモフィトン・フロッコサム (Epidermoph

10

20

30

40

50

yton floccosum)、アスペルギルス属種、例えばアスペルギルス・ニガーおよびアスペルギルス・フミガタス(Aspergillus fumigatus)など、トリコフィトン属種(Trichophyton species)、例えばトリコフィトン・メンタグロフィテス(Trichophyton mentagrophytes)など、ミクロスポロン属種(Microsporon species)、例えばミクロスポロン・カニス(Microsporon canis)およびミクロスポロン・オードウイニイ(Microsporon audouinii)などに対して、非常に広い抗真菌活性スペクトルを持つ。これらの真菌の列挙は、カバーすることができる真菌スペクトルを限定するものでは決してなく、単に例示のためのものである。

【0142】

本発明による化合物を施用する際、施用量を広い範囲内で変えることができる。本発明による処理方法において通常施用される活性化合物の用量/施用量は、一般に、および好都合には

- ・植物の部分、例として葉の処理(葉面処理)のために：0.1から10,000g/haまで、好ましくは10から1,000g/haまで、より好ましくは50から300g/haまで；灌注または点滴施用の場合、特にロックウールまたはパーライトなどの不活性基材を用いるときに、用量をなお低減させることができる；

- ・種子処理のために：100kgの種子あたり1から200gまで、好ましくは100kgの種子あたり2から150gまで、より好ましくは100kgの種子あたり2.5から25gまで、なおより好ましくは100kgの種子あたり2.5から25gまで；

- ・土壌処理のために：0.1から10,000g/haまで、好ましくは1から5,000g/haまで

である。

【0143】

本明細書中で指示されている用量は、本発明による方法の具体例として与えられる。当業者は、特に処理対象の植物または作物の特質に応じて、施用の用量を適合させる方法を知るものである。

【0144】

本発明による組み合わせは、処理後ある一定の時間の範囲内で有害生物および/または植物病原性真菌および/または微生物から植物を保護するために用いることができる。保護が有効である時間の範囲は、一般的に、組み合わせを使用した植物の処理後、1から28日、好ましくは1から14日、より好ましくは1から10日、なおより好ましくは1から7日、または植物繁殖材料の処理後200日までにわたる。

【0145】

さらには、本発明による組み合わせおよび組成物はまた、植物および収穫された植物材料中のマイコトキシンの含量を低減させ、したがって、それらから作られる食品および動物飼料中のマイコトキシンの含量を低減させるのに用いられ得る。排他的ではないが特に以下のマイコトキシンを特定することができる：デオキシニバレノール(DON)、ニバレノール、15-Ac-DON、3-Ac-DON、T2-およびHT2-毒素、フモニシン、ゼアラレノン、モニリホルミン、フザリン、ジアセオトキシスシルペノール(Diacetoxyscirpenol)(DAS)、ボウベリシン、エンニアチン、フザロプロリフェリン、フザレノール、オクラトキシン、パツリン、麦角アルカロイドおよびアフラトキシン。これらのマイコトキシンは、例えば、以下の真菌病に起因するものである：フザリウム属種、例えばフザリウム・アクミナツム(Fusarium acuminatum)、F.アベナシウム(F.avenaceum)、F.クルークウェレンス(F.crookwellense)、F.クルモラム、F.グラミネアルム(F.graminearum)(ジベレラ・ゼアエ)、F.エクイセチ、F.フジコロイ(F.fujikoroi)、F.ムサルム(F.musarum)、F.オキシスポルム、F.プロリフェラツム(F.proliferatum)、F.ポアエ(F.poaie)、F.シュードグラミネアルム(F.pseudograminearum)、F.サムブシ

10

20

30

40

50

ナム (*F. sambucinum*)、*F.* シルピ (*F. scirpi*)、*F.* セミテクタム、*F.* ソラニ (*F. solani*)、*F.* スポロトリコイデス (*F. sporotrichoides*)、*F.* ラングセチアエ (*F. langsethiae*)、*F.* サブグルチナンス (*F. subglutinans*)、*F.* トリシンクツム (*F. tricinatum*)、*F.* ベルチシリオイデス (*F. verticillioides*) などだけでなく、アスペルギルス属種、ペニシリウム属種、クラビセプス・ブルブレア、スタキボトリス属種 (*Stachybotrys spec.*) など。

【0146】

化合物 (B)、(C) または (D) と組み合わせた式 (I) の化合物またはその塩はまた、多数の植物作物、例えば経済的に重要な作物、例えば穀物 (コムギ、オオムギ、ライコムギ、ライムギ、イネ、コーン、キビ)、テンサイ、サトウキビ、アブラナ、ワタ、ヒマワリ、エンドウマメ、インゲンマメおよびダイズなどの作物における有害生物の選択的防除に適している。とりわけ興味深いのは、単子葉作物、例えば穀物 (コムギ、オオムギ、ライムギ、ライコムギ、ソルガム)、コーンおよびイネなど、ならびに単子葉野菜作物などにおける使用だけでなく、双子葉作物、例えば、ダイズ、アブラナ、ワタ、ブドウ、野菜植物、果実植物および観賞植物などにおける使用でもある。組み合わせは、有用植物 (作物) における有害植物の選択的防除のために好ましい。本発明による組み合わせはまた、有用植物および観賞植物の花壇および区画において、例えば、有用芝生または観賞用芝生、特にライグラス (*Lolium*)、イチゴツナギ (*meadow grass*) またはギョウギシバ (*Bermuda grass*) などを有する芝生区画において、有害植物を防除するのに適している。

【0147】

特定の実施形態において、化合物 (B)、(C) または (D) と組み合わせた式 (I) の化合物またはその塩はまた、ワタ、ワイン、穀物 (例えばコムギ、イネ、オオムギ、ライコムギなど)、トウモロコシ (コーン)、ダイズ、アブラナ、ヒマワリ、芝、園芸作物、低木、果樹および果実植物 (例えばリンゴの木、ナシの木 (*peer-tree*))、柑橘類、バナナ、コーヒーの木、イチゴ植物、ラズベリー植物など)、野菜の中から、とりわけ穀物、コーン、アブラナ、低木、果樹および果実植物、野菜およびブドウの中から選択される多数の植物における有害生物の選択的防除に適している。

【0148】

本発明による組み合わせが用いられ得る有用植物または作物植物の中からまた興味深いのは、ある種の駆除剤に対して完全にもしくは部分的に耐性である変異作物、または完全にもしくは部分的に耐性である遺伝子導入作物、例えばグルホシネートもしくはグリホサートに対して抵抗性であるコーン作物、または除草剤イミダゾリノンに対して抵抗性であるダイズ作物である。しかしながら、このような新規のやり方の組み合わせの特有の利点は、施用される駆除剤に通常は不十分に耐性である作物における、それらの効率的な作用である。

【0149】

したがって、本発明はまた、有効な有用植物保護量の 1 または複数の化合物 (I) を化合物 (B)、(C) もしくは (D) またはそれらの塩と組み合わせて、有害植物に対して有効な量の 1 または複数の除草剤の前、後またはこれらと同時に、植物、植物の部分、植物種子 (複数可) に施用することを含む、有用植物の作物における有害植物の選択的防除方法を提供する。

【0150】

T が酸素原子を表す式 (I) の N - シクロプロピルアミドは、3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボニルクロリドを使用した置換 N - シクロプロピルベンジルアミンの縮合により、WO - 2007 / 087906 (プロセス P1) および WO - 2010 / 130767 (プロセス P1 - ステップ 10) に従って調製することができる。

【0151】

置換 N - シクロプロピルベンジルアミンは公知であるか、または公知のプロセス、例えばシクロプロパンアミンを使用した置換アルデヒドの還元的アミノ化 (J . M e d . C h e m . , 2 0 1 2 , 5 5 (1) , 1 6 9 - 1 9 6) もしくはシクロプロパンアミンを使用した置換ベンジルアルキル (またはアリール) スルホネートもしくは置換ベンジルハライドの求核置換 (B i o o r g . M e d . C h e m . , 2 0 0 6 , 1 4 , 8 5 0 6 - 8 5 1 8 および W O - 2 0 0 9 / 1 4 0 7 6 9) などにより調製することができる。

【 0 1 5 2 】

3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボニルクロリドは、W O - 2 0 1 0 / 1 3 0 7 6 7 (プロセス P 1 - ステップ 9 または 1 1) に従って調製することができる。

【 0 1 5 3 】

T が硫黄原子を表す式 (I) の N - シクロプロピルチオアミドは、T が酸素原子を表す式 (I) の N - シクロプロピルアミドのチオ化により、W O - 2 0 0 9 / 0 1 6 2 2 0 (プロセス P 1) および W O - 2 0 1 0 / 1 3 0 7 6 7 (プロセス P 3) に従って調製することができる。

【 0 1 5 4 】

以下の例は、限定されない様式で、本発明による式 (I) の化合物の調製を説明する。

【実施例】

【 0 1 5 5 】

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドの調製 (化合物 A 1)

ステップ A : N - (2 - イソプロピルベンジル) シクロプロパンアミンの調製

9 0 0 m L のメタノール中 5 5 . 5 g (9 7 1 m m o l) のシクロプロパンアミン溶液に、2 0 g の 3 分子ふるいおよび 7 3 g (1 . 2 1 m o l) の酢酸を連続的に加える。7 2 g (4 8 6 m m o l) の 2 - イソプロピル - ベンズアルデヒドを次いで滴下して加え、反応混合物を還流しながら 4 時間、さらに加熱する。

【 0 1 5 6 】

反応混合物を次いで 0 まで冷却し、4 5 . 8 g (7 2 9 m m o l) のシアノ水素化ホウ素ナトリウムを少しずつ 1 0 分間かけて加え、反応混合物を還流しながら 3 時間再び攪拌する。冷却した反応混合物をケイソウ土のケーキに対してろ過する。ケーキをメタノールにより十分に洗浄し、メタノール抽出物を真空下で濃縮する。水を次いで残渣に加え、4 0 0 m L の 1 N 水酸化ナトリウム水溶液を使用して pH を 1 2 に調整する。水層を酢酸エチルで抽出し、水 (2 x 3 0 0 m L) により洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させることで、8 1 . 6 g (8 8 %) の N - (2 - イソプロピルベンジル) シクロプロパンアミンが黄色の油状物としてもたらされ、これはそのまま次のステップにおいて用いられる。

【 0 1 5 7 】

塩酸塩は、N - (2 - イソプロピルベンジル) シクロプロパンアミンをジエチルエーテル (1 . 4 m L / g) 中に 0 で溶解し、その後に 2 M のジエチルエーテル中の塩酸溶液 (1 . 0 5 当量) を加えることにより調製することができる。2 時間の攪拌後、N - (2 - イソプロピルベンジル) シクロプロパンアミン塩酸塩 (1 : 1) をろ過して分け、ジエチルエーテルにより洗浄し、真空下、4 0 で 4 8 時間乾燥させる。M p (融点) = 1 4 9

ステップ B : N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドの調製

1 L の無水テトラヒドロフラン中 4 0 . 8 g (1 9 2 m m o l) の N - (2 - イソプロピルベンジル) シクロプロパンアミンに、室温で、5 1 m L (3 6 6 m m o l) のトリエチルアミンを加える。8 0 0 m L の無水テトラヒドロフラン中 3 9 . 4 g (1 7 4 m m o l) の 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 -

10

20

30

40

50

カルボニルクロリド溶液を次いで、温度を34 未満に維持しながら、滴下して加える。反応混合物を還流しながら2時間加熱し、次いで一晩、室温に置く。塩をろ過して分け、ろ液を真空下で濃縮することで、78.7 gの褐色の油状物がもたらされる。シリカゲルに対するカラムクロマトグラフィー(750 g - グラジエント n - ヘプタン / 酢酸エチル)により53 g (71%の収率)のN - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドが黄色の油状物としてもたらされ、これは徐々に結晶化する。Mp = 76 ~ 79 。

【0158】

同様に、化合物A2からA19を、化合物A1について記載されている調製法に従って、調製することができる。

【0159】

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボチオアミドの調製 (化合物A20)

500 mlのジオキサン中14.6 g (65 mmol)の五硫化リンおよび48 g (131 mmol)のN - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドの溶液を100 で2時間加熱する。50 mlの水を次いで加え、反応混合物を100 てもう1時間、さらに加熱する。冷却した反応混合物を塩基性アルミナカートリッジに対してろ過する。カートリッジをジクロロメタンにより洗浄し、合わせた有機抽出物を硫酸マグネシウムで乾燥させ、真空下で濃縮することで、55.3 gのオレンジ色の油状物がもたらされる。残渣を数mLのジエチルエーテルで、結晶化が起こるまですりつぶす。結晶をろ過して分け、真空下、40 で15時間乾燥させることで、46.8 g (88%の収率)のN - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボチオアミドがもたらされる。Mp = 64 ~ 70 。

【0160】

表1は、化合物A1からA20のlog PおよびNMRデータ(¹H)を提供する。

【0161】

表1中、log P値は、EEC Directive 79/831 Annex V . A8に従って、逆相カラム(C18)に対するHPLC(高速液体クロマトグラフィー)により、以下に記載される方法を用いて決定された：
温度：40 ；移動相：0.1%ギ酸水溶液およびアセトニトリル；10%アセトニトリルから90%アセトニトリルまでの直線勾配。

【0162】

較正は、log P値が知られている非分岐鎖アルカン - 2 - オン(3から16個の炭素原子を含むもの)を用いて行った(2つの連続するアルカノン間の線形補間を用いた保持時間によるlog P値の決定)。ラムダマックス値は、200 nmから400 nmまでのUVスペクトルおよびクロマトグラフシグナルのピーク値を用いて決定した。

【表 1】

Cmpd	logP	NMR
A1	3.35	¹ H NMR (500 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.64 (bs, 4H), 1.21 (d, J=6.60 Hz, 6H), 2.44 - 2.80 (m, 1H), 3.01 - 3.29 (m, 1H), 3.78 (s, 3H), 4.76 (bs, 2H), 6.89 (t, J=54.70 Hz, 1H), 7.12 - 7.33 (m, 4H).
A2	3.44	¹ H NMR (500 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.47 - 0.77 (m, 6H), 0.80 - 1.04 (m, 2H), 1.92 (bs, 1H), 2.66 (bs, 1H), 3.80 (s, 3H), 4.92 (bs, 2H), 6.90 (t, J=54.50 Hz, 1H), 7.01 - 7.25 (m, 4H).
A3	4.06	¹ H NMR (500 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.61 (bs, 4H), 1.46 (s, 9H), 2.77 - 2.98 (m, 1H), 3.89 (s, 3H), 5.05 (bs, 2H), 6.91 (t, J=54.70 Hz, 1H), 7.20 (bs, 3H), 7.35 - 7.48 (m, 1H).
A4	3.76	¹ H NMR (300 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.65 - 0.69 (m, 4H), 1.21 (t, 3H), 2.62 - 2.64 (m, 3H), 3.81 (s, 3H), 4.70 (s, 2H), 6.85 (t, J=54.6 Hz, 1H), 7.04 - 7.22 (m, 3H).
A5	4.09	¹ H NMR (500 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.63 - 0.73 (m, 4H), 1.22 (d, J=6.92 Hz, 6H), 2.59 - 2.87 (m, 1H), 2.98 - 3.30 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 4.74 (bs, 2H), 6.88 (t, J=54.40 Hz, 1H), 7.20 - 7.27 (m, 3H).
A6	3.41	¹ H NMR (300 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.65 - 0.66 (m, 4H), 1.21 (t, 3H), 2.62 (q, 2H), 2.64 (bs, 1H), 3.81 (s, 3H), 4.71 (s, 2H), 6.86 (t, J=54.6 Hz, 1H), 6.89 - 6.95 (m, 2H), 7.13 - 7.18 (m, 1H).

10

20

Cmpd	logP	NMR
A7	3.70	¹ H NMR (300 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.65 - 0.69 (m, 4H), 1.22 (d, 6H), 2.69 (bs, 1H), 3.10 - 3.14 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 4.75 (s, 2H), 6.86 (t, J=54.6 Hz, 1H), 6.88 - 6.93 (m, 2H), 7.23 - 7.28 (m, 1H).
A8	3.46	¹ H NMR (300 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.60 - 0.66 (m, 6H), 0.89 - 0.95 (m, 2H), 1.82 - 1.84 (m, 1H), 2.73 (bs, 1H), 3.81 (s, 3H), 4.89 (s, 2H), 6.68 - 6.99 (m, 4H).
A9	4.21	¹ H NMR (300 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.64 - 0.68 (m, 4H), 1.56-1.62 (m, 2H), 1.62 - 1.70 (m, 2H), 1.76 - 1.83 (m, 2H), 1.96 - 2.05 (m, 2H), 2.71 (bs, 1H), 3.13 - 3.19 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 4.76 (s, 2H), 6.86 (t, J=54.0 Hz, 1H), 6.87 - 6.97 (m, 2H), 7.23 - 7.28 (m, 1H).
A10	3.65	¹ H NMR (400 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.65 (bs, 4H), 1.21 (d, J=6.75 Hz, 5H), 2.29 - 2.59 (m, 1H), 3.00 - 3.36 (m, 1H), 3.79 (s, 3H), 4.83 (s, 2H), 6.68 - 7.06 (m, 2H), 7.13 (d, J=7.78 Hz, 1H), 7.27 - 7.33 (m, 1H).
A11	3.70	¹ H NMR (500 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.65 (bs, 4H), 2.31 (s, 3H), 2.64 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 4.73 (bs, 2H), 6.89 (t, J=54.6 Hz, 1H), 7.01-7.14 (m, 3H).
A12	3.99	¹ H NMR (500 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.66 (bs, 4H), 1.22 (d, J=6.97 Hz, 6H), 2.31 (s, 3H), 2.54 - 2.75 (m, 1H), 2.99 - 3.25 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 4.75 (bs, 2H), 6.89 (t, J=53.90Hz, 1H), 7.01 - 7.23 (m, 3H).
A13	3.76	¹ H NMR (500 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.61 - 0.68 (m, 6H), 0.80 - 1.00 (m, 2H), 1.74 - 2.00 (m, 1H), 2.31 (s, 3H), 2.53 - 2.82 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 4.89 (bs, 2H), 6.83 (t, J=54.80 Hz, 1H), 6.91 - 7.06 (m, 3H).
A14	4.36	¹ H NMR (500 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.62 (m, 4H), 1.44 (s, 9H), 2.28 (s, 3H), 2.74 - 3.02 (m, 1H), 3.83 (bs, 3H), 5.02 (bs, 2H), 6.85 (t, J=54.40 Hz, 1 H), 7.01 (bs, 1H), 7.21 - 7.29 (m, 2 H).
A15	3.80	¹ H NMR (500 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.50 - 0.67 (m, 4H), 2.81 (bs, 1H), 3.78 (s, 3H), 4.85 (bs, 2H), 6.78 (t, J=55.00 Hz, 1H), 7.20 - 7.29 (m, 2H), 7.54 (d, J=8.17 Hz, 1H).
A16	3.78	¹ H NMR (500 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.55 - 0.70 (m, 4H), 2.37 (s, 3H), 2.72 - 3.04 (m, 1H), 3.83 (bs, 3H), 4.91 (bs, 2H), 6.86 (t, J=54.50 Hz, 1H), 7.10 - 7.20 (m, 2H), 7.54 (d, J=7.89 Hz, 1H).
A17	3.46	¹ H NMR (500 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.47 - 0.64 (m, 4H), 2.29 - 2.55 (m, 1H), 3.80 (s, 3H), 5.05 (s, 2H), 6.95 (t, J=54.40 Hz, 1H), 7.40 (t, J=7.86 Hz, 1H), 7.60 - 7.70 (dd, 2H).

10

20

30

40

Cmpd	logP	NMR
A18	3.62	¹ H NMR (500 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.50 - 0.74 (m, 4H), 2.45 - 2.71 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 4.99 (s, 2H), 6.91 (t, J=54.40 Hz, 1H), 7.45 - 7.57 (m, 2H).
A19	4.04	¹ H NMR (500 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.65 (bs, 4H), 1.20 (t, J=7.43 Hz, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.58 - 2.64 (m, 2H), 3.80 (s, 3H), 4.70 (bs, 2H), 6.89 (t, J=54.70 Hz, 3H), 6.98 (bs, 2H).
A20	4.36	¹ H NMR (500 MHz, CHCl ₃ -d): δ ppm 0.55 - 0.84 (m, 4H), 1.27 (d, J=6.97 Hz, 6H), 2.73 - 2.85 (m, 1H), 3.04 - 3.23 (m, 1H), 3.80 (s, 3H), 4.60 - 5.06 (m, 1H), 6.99 - 7.38 (m, 5H).

10

【 0 1 6 3 】

本発明による活性化化合物の組み合わせの良好な殺真菌活性は、下の例から明らかである。個々の活性化化合物は殺真菌活性に関して弱さを呈するが、組み合わせは活性の単なる相加を超える活性を持つ。殺真菌剤の相乗効果は、活性化化合物の組み合わせの殺真菌活性が個別に施用されたときの活性化化合物の活性の合計を超える場合に、常に存在する。2の活性化化合物の所与の組み合わせについての予想される活性は、以下のように算出することができる (Colby, S. R., "Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations", Weeds 1967, 15, 20 - 22を参照されたい) :

20

Xが、活性化化合物Aが m ppm (または g / ha) の施用量で施用されたときの効力であり、

Yが、活性化化合物Bが n ppm (または g / ha) の施用量で施用されたときの効力であり、

Eが、活性化化合物AおよびBがそれぞれ m および n ppm (または g / ha) の施用量で施用されたときの効力である場合、

30

【 数 1 】

$$E = X + Y - \frac{X \cdot Y}{100}$$

【 0 1 6 4 】

である。

【 0 1 6 5 】

効力の度合いは、%で表したものが示される。0%は対照の効力に相当する効力を意味し、100%の効力は病害が観察されないことを意味する。実際の殺真菌活性が計算値を超える場合、組み合わせの活性は超相加的であり、すなわち相乗効果が存在する。この場合、実際に観測された効力は、上述の式から算出された予想効力 (E) の値より必ず大きくなる。相乗効果を実証するさらなるやり方は、Tammesの方法である (Neth. J. Plant Path., 1964, 70, 73 - 80中の "Isoboles, a graphic representation of synergism in pesticides" を参照されたい)。

40

【 0 1 6 6 】

例A : ブルメリア試験 (オオムギ) / 予防的

溶媒 : 49重量部のN, N - ジメチルアセトアミド

乳化剤 : 1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

50

活性化合物の好適な調合剤を生産するため、1重量部の活性化合物または活性化合物の組み合わせを定められた量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度に希釈する。

【0167】

予防活性について試験するため、幼植物に活性化合物または活性化合物の組み合わせの調合剤を、定められた施用量で噴霧する。

【0168】

噴霧コーティングが乾燥した後、植物にブルメリア・グラミニス・フォルマ・スペシャリス・ホルデイ (*Blumeria graminis f. sp. hordei*) の胞子を振りかける。

【0169】

植物を温室内に、約18℃の温度および約80%の大気相対湿度で置き、ウドンコ病のイボ (*pustule*) の発達を促す。

【0170】

試験は接種7日後に評価する。0%は処理されていない対照の効力に相当する効力を意味し、100%の効力は病害が観察されないことを意味する。

【0171】

下の表は、本発明による活性化合物の組み合わせの観測された活性が計算された活性よりも高い、すなわち相乗効果が存在することを明白に示す。

【0172】

ブルメリア試験 (オオムギ) / 予防的

【表2】

活性化合物	ppm で表した活性化合物の施用量 a.i.	%で表した効力	
		観測値*	計算値**
(A5) 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-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	62.5	56	
(B-14.1) グリホサート	5	11	
(B-13.3) グルホシネート - アンモニウム	5	0	
(A5) + (B-14.1) 12.5:1	62.5 + 5	89	61
(A5) + (B-13.3) 12.5:1	62.5 + 5	94	56

* 観測値 = 観測された活性

** 計算値 = Colby 式を用いて算出された活性

【0173】

例 B : レプトスフェリア・ノドラム試験 (コムギ) / 予防的

溶媒 : 49重量部の N, N - ジメチルアセトアミド

乳化剤 : 1重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の好適な調合剤を生産するため、1重量部の活性化合物または活性化合物の組み合わせを定められた量の溶媒および乳化剤と混合し、濃縮物を水で所望の濃度に希釈する。

【 0 1 7 4 】

予防活性について試験するため、幼植物に活性化合物または活性化合物の組み合わせの調合剤を、定められた施用量で噴霧する。

【 0 1 7 5 】

噴霧コーティングが乾燥した後、植物にレプトスフェリア・ノドラムの孢子懸濁液を噴霧する。植物を48時間、インキュベーションキャビネット内で、約20%、約100%の大気相対湿度でそのままにする。

【 0 1 7 6 】

植物を温室内に、約22%の温度および約80%の大気相対湿度で置く。

【 0 1 7 7 】

試験は接種8日後に評価する。0%は処理されていない対照の効力に相当する効力を意味し、100%の効力は病害が観察されないことを意味する。

【 0 1 7 8 】

下の表は、本発明による活性化合物の組み合わせの観測された活性が計算された活性よりも高い、すなわち相乗効果が存在することを明白に示す。

【 0 1 7 9 】

レプトスフェリア・ノドラム試験（コムギ）／予防的

【表3】

活性化合物	ppm で表した活性化合物の施用量 a.i.	%で表した効力	
		観測値*	計算値**
(A5) 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-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	31	50	
(D-23) メフェンピル - ジエチル	25	17	
(D-19) イソオキサジフェン - エチレン	25	17	
(D-62) シプロスルファミド	25	0	
(A5) + (D-23) 1.24:1	31 + 25	67	59
(A5) + (D-19) 1.24:1	31 + 25	83	59
(A5) + (D-62) 1.24:1	31 + 25	83	50

* 観測値 = 観測された活性

** 計算値 = Colby 式を用いて算出された活性

フロントページの続き

(51)Int.Cl. F I
A 0 1 N 41/06 B
A 0 1 P 3/00

(74)代理人 100137213
弁理士 安藤 健司

(74)代理人 100146318
弁理士 岩瀬 吉和

(74)代理人 100127812
弁理士 城山 康文

(72)発明者 クリストー、ピエール
フランス国、エフ - 6 9 0 0 9 ・ リヨン、リュ・マリートン・4

(72)発明者 ダーメン、ペーター
ドイツ国、4 1 4 7 0 ・ ノイス、アルテブルツカーシュトラッセ・6 3

審査官 水島 英一郎

(56)参考文献 国際公開第 2 0 1 0 / 1 3 0 7 6 7 (W O , A 1)
特表 2 0 0 8 - 5 4 2 4 0 9 (J P , A)

(58)調査した分野(Int.Cl. , D B 名)
A 0 1 N , A 0 1 P
C A p l u s (S T N)
R E G I S T R Y (S T N)