

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第6662901号
(P6662901)

(45) 発行日 令和2年3月11日 (2020.3.11)

(24) 登録日 令和2年2月17日 (2020.2.17)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 401/04 (2006.01)

C O 7 D 401/04 C S P

A O 1 N 43/52 (2006.01)

A O 1 N 43/52

A O 1 P 3/00 (2006.01)

A O 1 P 3/00

請求項の数 15 (全 100 頁)

(21) 出願番号 特願2017-550509 (P2017-550509)
 (86) (22) 出願日 平成28年3月21日 (2016.3.21)
 (65) 公表番号 特表2018-513136 (P2018-513136A)
 (43) 公表日 平成30年5月24日 (2018.5.24)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2016/056127
 (87) 国際公開番号 W02016/156085
 (87) 国際公開日 平成28年10月6日 (2016.10.6)
 審査請求日 平成31年3月19日 (2019.3.19)
 (31) 優先権主張番号 15161494.8
 (32) 優先日 平成27年3月27日 (2015.3.27)
 (33) 優先権主張国・地域又は機関
 欧州特許庁 (EP)

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

最終頁に続く

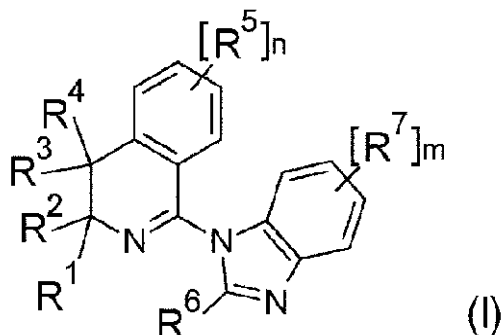
(54) 【発明の名称】 殺微生物性二環式複素環式誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物：

【化 1】



(式中、

R_1 および R_2 は各々、水素、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルおよび $C_2 \sim C_6$ アルキニルから独立して選択され、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ

および $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてよく；または

R_1 および R_2 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル基（ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてよい）を表し；

R_3 および R_4 は各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルおよび $C_2 \sim C_6$ アルキニルから独立して選択され、ここで、前記アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてよく；または

R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C = O$ 、 $C = NOR_a$ 、 $C = C(R_b)(R_c)$ もしくは $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル（ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてよい）を表し；または

R_2 および R_3 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルキル（ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてよく、ならびに、追加的に、環炭素単位は酸素または硫黄原子により置き換えられていてもよい）を表し；

各 R_5 は独立して、ハロゲン、ヒドロキシル、メルカプト、ニトロ、シアノ、ホルミル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $-C(=NOR_a)C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、アリール、ヘテロアリール、アリールオキシまたはヘテロアリールオキシを表し、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アリールおよびヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、シアノおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 5 個の置換基で置換されていてよく； n は、0、1、2、3 または 4 であり；

R_6 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ アルコキシであり；

各 R_7 は独立して、ヒドロキシル、メルカプト、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシまたは $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシを表し； m は、0、1、2、3 または 4 であり；または

2 つの隣接する R_7 置換基は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_5 \sim C_7$ シクロアルキル（ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてよく、ならびに、追加的に、環炭素単位は酸素または硫黄原子により置き換えられていてもよい）を表し；

R_a は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルおよび $C_3 \sim C_6$ アルキニルから選択され、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてよく；

R_b および R_c は各々、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択され、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてよい）；または、その塩もし

くはN - オキシド。

【請求項2】

R_1 および R_2 が各々、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルおよび $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、前記アルキルおよびシクロアルキル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されているとしてもよく；または

R_1 および R_2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基（ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されているともよい）を表し；または

R_2 および R_3 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_5 \sim C_7$ シクロアルキル（ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されているとしてもよく、ならびに、追加的に、環炭素単位は酸素または硫黄原子により置き換えられているともよい）を表す、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R_3 および R_4 が各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、前記アルキル、アルコキシおよびシクロアルキル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されているとしてもよく；または

R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ 、 $C=NOR_a$ 、 $C=C(R_b)(R_c)$ もしくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル（ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されているともよい）を表し；または

R_2 および R_3 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_5 \sim C_7$ シクロアルキル（ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されているとしてもよく、ならびに、追加的に、環炭素単位は酸素または硫黄原子により置き換えられているともよい）を表す、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

各 R_5 が独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $-C(=NOR_a)C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、ヘテロアリール（ここで、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリールオキシ（ここで、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）を表し、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、フェニルおよびヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、シアノおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～5個の置換基で置換されているとしてもよく； n が、0、1、2、3または4である、請求項1、2または3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項5】

R_6 が、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである、請求項1、2、3または4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

各 R_7 が独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシまたは $C_3 \sim C_6$

10

20

30

40

50

アルキニルオキシであり； m が、0、1、2、3または4であり；または

2つの隣接する R_7 置換基が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_5 \sim C_7$ シクロアルキル基（ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されているともよく、ならびに、追加的に、環炭素単位は酸素または硫黄原子により置き換えられていてもよい）を表す、

請求項1、2、3、4または5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項7】

R_1 および R_2 が各々、水素および $C_1 \sim C_4$ アルキルから独立して選択され、ここで、前記アルキル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されているともよく；または

R_1 および R_2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基（ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されているともよい）を表す、請求項1、2、3、4、5または6のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項8】

R_3 および R_4 が各々、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルおよび $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、前記アルキルおよびシクロアルキル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されているともよく；または

R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ 、 $C=NOR_a$ または $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル（ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されているともよい）を表す、請求項1、2、3、4、5、6または7のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項9】

各 R_5 が独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ、 $-C(=NOR_a)C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、ヘテロアリール（ここで、ヘテロアリールは、ピリジル、チアゾリルまたはオキサゾリルである）を表し、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、フェニルおよびヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキルおよび $C_1 \sim C_3$ アルコキシから独立して選択される1～3個の置換基で置換されているともよく； n が、0、1または2である、

請求項1、2、3、4、5、6、7または8のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項10】

R_6 が、水素または $C_1 \sim C_3$ アルキルである、請求項1、2、3、4、5、6、7、8または9のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項11】

R_1 および R_2 が各々、水素および $C_1 \sim C_4$ アルキルから独立して選択され、ここで、前記アルキル基は、ハロゲン、メトキシおよびメチルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されているともよく；または

R_1 および R_2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル基（ハロゲンおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されているともよい）を表し；

R_3 および R_4 が各々、水素、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_4$ アルキルから独立して選択され、ここで、前記アルキル基は、ハロゲン、メトキシおよびメチルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されているともよく；または

R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ 、 $C=NOR_a$ または $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル（ハロゲンおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルからなる群から独立

10

20

30

40

50

して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい) を表し ;

各 R_5 が独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルまたはフェニルを表し、ここで、前記アルキル、シクロアルキルおよびフェニル基は、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_3$ アルキルから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよく ; n が 0、1 または 2 であり ;

R_6 が水素またはメチルであり ;

各 R_7 が独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオまたは $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し ; m が 0、1 または 2 であり ; ならびに

R_a が、水素および $C_1 \sim C_4$ アルキルから選択され、ここで、前記アルキル基は、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよい、
請求項 1 に記載の化合物またはその塩もしくは N - オキシド。 10

【請求項 1 2】

R_1 および R_2 が各々、水素および $C_1 \sim C_3$ アルキルから独立して選択され ; または

R_1 および R_2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル基を表し ;

R_3 および R_4 が各々、水素、フルオロまたは $C_1 \sim C_3$ アルキルから独立して選択され ; または

R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C = O$ もしくは $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し ; 20

各 R_5 が独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し、ここで前記アルキルおよびシクロアルキル基は、1 ~ 3 個のフッ素原子で置換されていてもよく ; n が 0、1 または 2 であり ;

R_6 が水素であり ; ならびに

各 R_7 が独立して、フルオロ、クロロまたは $C_1 \sim C_3$ アルキルを表し ; m が 1 または 2 である、
請求項 1 に記載の化合物またはその塩もしくは N - オキシド。

【請求項 1 3】

殺菌的に有効な量の請求項 1 ~ 1 2 のいずれかに定義される式 (I) の化合物を含む組成物。 30

【請求項 1 4】

少なくとも 1 種の追加の活性成分および / または希釈剤をさらに含む、請求項 1 3 に記載の組成物。

【請求項 1 5】

植物病原性微生物の駆除、予防または防除方法であって、植物病原体、植物病原体の生息地、または、植物病原体による被害を受けやすい植物、もしくはその繁殖体に、殺菌的に有効な量の請求項 1 ~ 1 2 のいずれかに定義される式 (I) の化合物、または殺菌的に有効な量の請求項 1 ~ 1 2 のいずれかに定義される式 (I) の化合物を含む組成物を適用することを含む方法。

【発明の詳細な説明】 40

【技術分野】

【0 0 0 1】

本発明は、例えば、特に殺菌 (fungicidal) 活性といった殺微生物活性を有する活性成分としての殺微生物二環式複素環式誘導体に関する。本発明はまた、これらの二環式複素環式誘導体の調製、これらの二環式複素環式誘導体の調製に有用な中間体、これらの中間体の調製、少なくとも 1 種の二環式複素環式誘導体を含む農芸化学組成物、これらの組成物の調製、および、農業または園芸における、植物、収穫された食品作物、種子または非生体材料に対する特に菌類 (fungi) といった植物病原性微生物による外寄生を防除もしくは予防するための二環式複素環式誘導体または組成物の使用に関する。

【背景技術】 50

【 0 0 0 2 】

一定の殺菌性ヘテロ二環式化合物が国際公開第 0 5 0 7 0 9 1 7 号パンフレットに記載されている。

【 0 0 0 3 】

意外なことに、一定の新規二環式複素環式誘導体が有利な殺菌特性を有することがここに見いだされた。

【 発明の概要 】

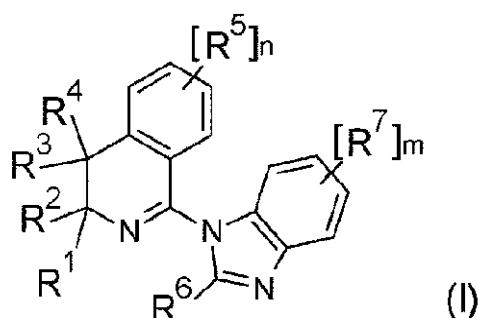
【 課題を解決するための手段 】

【 0 0 0 4 】

本発明は従って、式 I の化合物

【 化 1 】

10



(I)

20

(式中、

R_1 および R_2 は各々、水素、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルおよび $C_2 \sim C_6$ アルキニルから独立して選択され、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ～ 3 個の置換基で置換されていてもよく；または

R_1 および R_2 は、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル基（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される 1 ～ 3 個の置換基で置換されていてもよい）を表し；

30

R_3 および R_4 は各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルおよび $C_2 \sim C_6$ アルキニルから独立して選択され、ここで、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ～ 3 個の置換基で置換されていてもよく；または

R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C=O$ 、 $C=NOR_a$ 、 $C=C(R_b)(R_c)$ もしくは $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される 1 ～ 3 個の置換基で置換されていてもよい）を表し；または

40

R_2 および R_3 は、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C_5 \sim C_{10}$ シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される 1 ～ 3 個の置換基で置換されていてもよく、ならびに、追加的に、環炭素単位は酸素または硫黄原子により置き換えられていてもよい）を表し；

各 R_5 は独立して、ハロゲン、ヒドロキシル、メルカプト、ニトロ、シアノ、ホルミル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $-C(=NOR_a)C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、アリール、ヘテロアリール、アリールオキシまたはヘテロアリールオキシを表し、ここ

50

で、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アリールおよびヘテロアリール基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、シアノおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～5個の置換基で置換されていてもよく； n は、0、1、2、3または4であり；

R_6 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ アルコキシであり；

各 R_7 は独立して、ヒドロキシル、メルカプト、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシもしくは $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシを表し； m は、0、1、2、3もしくは4であり；または

2つの隣接する R_7 置換基は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_5 \sim C_7$ シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく、ならびに、追加的に、環炭素単位は酸素または硫黄原子により置き換えられていてもよい）を表し；

R_a は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルおよび $C_3 \sim C_6$ アルキニルから選択され、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく；

R_b および R_c は各々、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択され、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）；または、その塩もしくはN-オキシドを提供する。

【発明を実施するための形態】

【0005】

第2の態様において、本発明は、式(I)の化合物を含む農芸化学組成物を提供する。

【0006】

式(I)の化合物は植物病原性微生物の防除に用いられ得る。それ故、植物病原体を防除するために、本発明に係る式(I)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物は、植物病原体に直接、または、植物病原体の生息地（特に植物病原体による被害を受けやすい植物）に適用され得る。

【0007】

それ故、第3の態様において、本発明は、植物病原体を防除するための本明細書に記載の式(I)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物の使用を提供する。

【0008】

さらなる態様において、本発明は、本明細書に記載の式(I)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物を、前記植物病原体、または、前記植物病原体の生息地（特に植物病原体による被害を受けやすい植物）に適用するステップを含む植物病原体の防除方法を提供する。

【0009】

式(I)の化合物は、植物病原性菌の防除に特に効果的である。

【0010】

それ故、さらなる態様において、本発明は、植物病原性菌を防除するための本明細書に記載の式(I)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物の使用を提供する。

【0011】

さらなる態様において、本発明は、本明細書に記載の式(I)の化合物または式(I)

10

20

30

40

50

の化合物を含む組成物を、前記植物病原性菌、または、前記植物病原性菌の生息地（特に植物病原性菌による被害を受けやすい植物）に適用するステップを含む植物病原性菌の防除方法を提供する。

【 0 0 1 2 】

置換基が任意選択により置換されていると示されている場合、これは、これらの置換基が、1個以上の同等もしくは異なる置換基、例えば1～3個の置換基を有していてもいなくてもよいことを意味する。通常、3個以下のこのような任意選択の置換基が同時に存在する。1個の基が置換されていると示されている場合（例えばアルキル）、これは、他の基の一部であるこれらの基を含む（例えばアルキルチオ中のアルキル）。

【 0 0 1 3 】

「ハロゲン」という用語は、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を指し、好ましくはフッ素、塩素または臭素を指す。

【 0 0 1 4 】

アルキル置換基は直鎖または分岐であり得る。アルキルは、それ自体、または、他の置換基の一部として、記載されている炭素原子の数に応じて、例えば、メチル、エチル、*n*-プロピル、*n*-ブチル、*n*-ペンチル、*n*-ヘキシルおよびこれらの異性体、例えば、イソ-プロピル、イソ-ブチル、*sec*-ブチル、*t*-ブチルまたはイソ-アミルである。

【 0 0 1 5 】

アルケニル置換基は直鎖または分岐鎖の形態であることが可能であり、このアルケニル部分は、適切な場合、(E)-または(Z)-立体構成のものであることが可能である。例はビニルおよびアリルである。アルケニル基は、好ましくは $C_2 \sim C_6$ 、より好ましくは $C_2 \sim C_4$ 、および、最も好ましくは $C_2 \sim C_3$ アルケニル基である。

【 0 0 1 6 】

アルキニル置換基は、直鎖または分岐鎖の形態であることが可能である。例はエチニルおよびプロパルギルである。アルキニル基は、好ましくは $C_2 \sim C_6$ 、より好ましくは $C_2 \sim C_4$ 、および、最も好ましくは $C_2 \sim C_3$ アルキニル基である。

【 0 0 1 7 】

ハロアルキル基は1個以上の同等または異なるハロゲン原子を含有し得、例えば、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_3CH_2 、 CH_3CF_2 、 CF_3CF_2 または CCl_3CCl_2 を表し得る。

【 0 0 1 8 】

ハロアルケニル基はそれぞれアルケニル基であり、これらは、1つ以上の同一または異なるハロゲン原子で置換されており、例えば、2,2-ジフルオロビニルまたは1,2-ジクロロ-2-フルオロ-ビニルである。

【 0 0 1 9 】

ハロアルキニル基はそれぞれアルキニル基であり、これらは、1つ以上の同一または異なるハロゲン原子で置換されており、例えば1-クロロ-プロパ-2-イニルである。

【 0 0 2 0 】

アルコキシはラジカル-ORを意味し、式中、例えば上記に定義されているとおり、Rはアルキルである。アルコキシ基としては、これらに限定されないが、メトキシ、エトキシ、1-メチルエトキシ、プロポキシ、ブトキシ、1-メチルプロポキシおよび2-メチルプロポキシが挙げられる。

【 0 0 2 1 】

シアノは-CN基を意味する。

【 0 0 2 2 】

アミノは-NH₂基を意味する。

【 0 0 2 3 】

ヒドロキシルまたはヒドロキシは、-OH基を指す。

【 0 0 2 4 】

10

20

30

40

50

アリール基（単独で、または、例えばアリールオキシ、アリール - アルキルなどのより大きな基の一部として）は、単環式、二環式または三環式の形態であることが可能である芳香族環系である。このような環の例としては、フェニル、ナフチル、アントラセニル、インデニルまたはフェナントレニルが挙げられる。好ましいアリール基はフェニルおよびナフチルであり、フェニルが最も好ましい。アリール部分が置換されていると言われる場合、このアリール部分は、好ましくは 1 ~ 4 個の置換基、最も好ましくは 1 ~ 3 個の置換基で置換されている。

【 0 0 2 5 】

ヘテロアリール基（単独で、または、例えばヘテロアリールオキシ、ヘテロアリール - アルキルなどのより大きな基の一部として）は、少なくとも 1 個のヘテロ原子を含有すると共に、単一の環または 2 つ以上の縮合環から構成される芳香族環系である。好ましくは、単一の環は 3 個以下のヘテロ原子を含有し、二環系は 4 個以下のヘテロ原子を含有することとなり、これらは、窒素、酸素および硫黄から好ましく選択されることとなる。単環式基の例としては、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル（例えば [1 , 2 , 4] トリアゾリル）、フラニル、チオフェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、チアゾリル、イソチアゾリルおよびチアジアゾリルが挙げられる。二環式基の例としては、プリニル、キノリニル、シノリニル、キノキサリニル、インドリル、インダゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾチオフェニルおよびベンゾチアゾリルが挙げられる。単環式ヘテロアリール基が好ましく、ピリジルが最も好ましい。ヘテロアリール部分が置換されていると言われる場合、このヘテロアリール部分は、好ましくは 1 ~ 4 個の置換基、最も好ましくは 1 ~ 3 個の置換基で置換されている。

【 0 0 2 6 】

ヘテロシクリル基または複素環（単独で、または、ヘテロシクリル - アルキルなどのより大きな基の一部として）は、O、S および N から選択される 1 個以上（好ましくは 1 個、2 個または 3 個）のヘテロ原子を含む 10 個以下の原子を含有する非芳香族環構造である。単環式基の例としては、オキセタニル、4 , 5 - ジヒドロ - イソオキサゾリル、チエタニル、ピロリジニル、テトラヒドロフラニル、[1 , 3] ジオキサニル、ピペリジニル、ピペラジニル、[1 , 4] ジオキサニル、イミダゾリジニル、[1 , 3 , 5] オキサジアジナニル、ヘキサヒドロ - ピリミジニル、[1 , 3 , 5] トリアジナニルおよびモルホリニル、または、1 - オキソ - チエタニルおよび 1 , 1 - ジオキソ - チエタニルなどのこれらの酸化型が挙げられる。二環式基の例としては、2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾフラニル、ベンゾ [1 , 4] ジオキサニル、ベンゾ [1 , 3] ジオキサニル、クロメニルおよび 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシニルが挙げられる。ヘテロシクリル部分が置換されていると言われる場合、このヘテロシクリル部分は、好ましくは 1 ~ 4 個の置換基、最も好ましくは 1 ~ 3 個の置換基で置換されている。

【 0 0 2 7 】

式 I の化合物中に 1 個以上の不斉炭素原子の存在が可能であるとは、その化合物が光学異性形態、すなわち、鏡像異性形態またはジアステレオ異性形態をとり得ることを意味する。また、単結合に係る回転の制限によってアストロプ異性体が生じ得る。式 I は、すべてのこれらの可能性のある異性形態およびその混合物を含むことが意図されている。本発明は、式 I の化合物に係るすべてのこれらの可能性のある異性形態およびその混合物を含む。同様に、式 I は、すべての可能性のある互変異性体を含むことが意図されている。本発明は、式 I の化合物に係るすべての可能性のある互変異性形態を含む。

【 0 0 2 8 】

各事例において、本発明に係る式 I の化合物は、遊離形態、N - オキシドとしての酸化型、または、例えば農業経済学的に使用可能な塩形態といった塩形態である。

【 0 0 2 9 】

N - オキシドは、第三級アミンの酸化型、または、窒素含有芳香族複素環式化合物の酸化型である。これらは、例えば、書籍 “ H e t e r o c y c l i c N - o x i d e s ”

10

20

30

40

50

, A. Albini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991に記載されている。

【0030】

本発明に係る式Iの化合物は遊離形態にあることが好ましい。

【0031】

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R_a 、 R_b 、 R_c 、 n および m の好ましい値は、任意のこれらの組み合わせで、以下に規定されているとおりである；

好ましくは、 R_1 および R_2 は各々、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルおよび $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく；または、 R_1 および R_2 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）を表す。

【0032】

より好ましくは、 R_1 および R_2 は各々、水素および $C_1 \sim C_4$ アルキルから独立して選択され、ここで、アルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく；または、 R_1 および R_2 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）を表す。

【0033】

さらに好ましくは、 R_1 および R_2 は各々、水素および $C_1 \sim C_4$ アルキルから独立して選択され、ここで、アルキル基は、任意選択により、ハロゲン、メトキシおよびメチルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく；または、 R_1 および R_2 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル基（これは、任意選択により、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）を表す。

【0034】

さらに好ましくは、 R_1 および R_2 は各々、水素および $C_1 \sim C_3$ アルキルから独立して選択され；または、 R_1 および R_2 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル基を表す。

【0035】

最も好ましくは、 R_1 および R_2 は各々、水素および $C_1 \sim C_3$ アルキルから独立して選択され；または、 R_1 および R_2 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル基を表す。

【0036】

好ましくは、 R_3 および R_4 は各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキル、アルコキシおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく；または、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C = O$ 、 $C = NOR_a$ 、 $C = C(R_b)(R_c)$ もしくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）を表し；または R_2 および R_3 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_5 \sim C_7$ シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく、ならびに、追加的に、環炭素単位は酸素または硫黄

原子により置き換えられていてもよい)を表す。

【0037】

より好ましくは、 R_3 および R_4 は各々、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルおよび $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく；または、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ 、 $C=NOR_a$ または $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル(これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい)を表す。

10

【0038】

さらに好ましくは、 R_3 および R_4 は各々、水素、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_4$ アルキルから独立して選択され、ここで、アルキル基は、任意選択により、ハロゲン、メトキシおよびメチルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく；または、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ 、 $C=NOR_a$ または $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル(これは、任意選択により、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい)を表す。

【0039】

さらに好ましくは、 R_3 および R_4 は各々、水素、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルから独立して選択され；または、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ 、 $C=NOR_a$ または $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表す。

20

【0040】

最も好ましくは、 R_3 および R_4 は各々、水素、フルオロまたは $C_1 \sim C_3$ アルキルから独立して選択され；または、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ または $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表す。

【0041】

好ましくは、各 R_5 は独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $-C(=NOR_a)C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、ヘテロアリール(式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフエニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである)、フェノキシまたはヘテロアリールオキシ(式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフエニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである)を表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、フェニルおよびヘテロアリール基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、シアノおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～5個の置換基で置換されていてもよく； n は、0、1、2、3または4である。

30

【0042】

より好ましくは、各 R_5 は独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ、 $-C(=NOR_a)C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、ヘテロアリール(式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チアゾリルまたはオキサゾリルである)を表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、フェニルおよびヘテロアリール基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキルおよび $C_1 \sim C_3$ アルコキシから独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく； n は、0、1または2である。

40

【0043】

さらに好ましくは、各 R_5 は独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルまたはフェニルを表し、ここで、アルキル、シクロアルキルおよび

50

フェニル基は、任意選択により、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_3$ アルキルから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよく； n は 0、1 または 2 である。

【0044】

さらにより好ましくは、各 R_5 は独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルまたはフェニルを表し、ここで、アルキル、シクロアルキルおよびフェニル基は、任意選択により、1 ~ 3 個のハロゲン原子で置換されていてもよく； n は 0、1 または 2 である。

【0045】

最も好ましくは、各 R_5 は独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し、ここでアルキルおよびシクロアルキル基は、任意選択により、1 ~ 3 個のフルオロ原子で置換されていてもよく； n は 0、1 または 2 である。

10

【0046】

好ましくは、 R_6 は、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0047】

より好ましくは、 R_6 は水素または $C_1 \sim C_3$ アルキルである。

【0048】

さらにより好ましくは、 R_6 は水素またはメチルである。

【0049】

最も好ましくは、 R_6 は水素である。

【0050】

20

好ましくは、各 R_7 は独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシもしくは $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシであり； m は、0、1、2、3 もしくは 4 であり；または

2 つの隣接する R_7 置換基は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_5 \sim C_7$ シクロアルキル基（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよく、ならびに、追加的に、環炭素単位は酸素または硫黄原子により置き換えられていてもよい）を表す。

30

【0051】

より好ましくは、各 R_7 は独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシまたは $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシを表し； m は、0、1、2 もしくは 3 であり；または

2 つの隣接する R_7 置換基は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_5 \sim C_6$ シクロアルキル基を表す。

【0052】

40

さらにより好ましくは、各 R_7 は独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオまたは $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し； m は 0、1 または 2 である。

【0053】

さらにより好ましくは、各 R_7 は独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し； m は 0、1 または 2 である。

【0054】

最も好ましくは、各 R_7 は独立して、フルオロ、クロロまたは $C_1 \sim C_3$ アルキルを表し； m は 1 または 2 である。

【0055】

50

好ましくは、 R_a は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルおよび $C_3 \sim C_6$ アルキニルから選択され、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されているともよい。

【0056】

より好ましくは、 R_a は、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキルおよび $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルから選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されているともよい。

10

【0057】

さらにより好ましくは、 R_a は水素および $C_1 \sim C_4$ アルキルから選択され、ここで、アルキル基は、任意選択により、1～3個のハロゲン原子で置換されているともよい。

【0058】

最も好ましくは、 R_a は水素および $C_1 \sim C_3$ アルキルから選択され、ここで、アルキル基は、任意選択により、1～3個のフルオロ原子で置換されているともよい。

【0059】

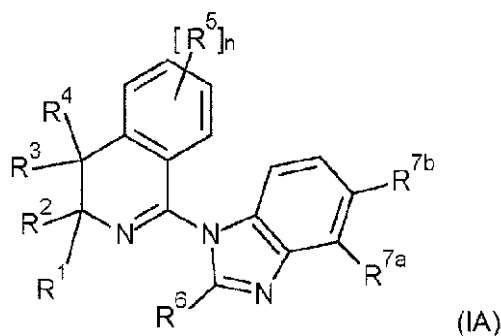
好ましくは、 R_b および R_c は各々、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択され、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されているともよい。

20

【0060】

本発明に係る化合物の好ましい群は、式IAのもの：

【化2】



30

(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R_a 、 R_b 、 R_c 、 n および m は、式Iの化合物に定義されているとおりである)、または、その塩もしくはN-オキシドである。 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R_a 、 R_b 、 R_c 、 n および m の好ましい定義は式Iの化合物に定義されているとおりである。

40

【0061】

本発明に係る化合物の他の好ましい群は、

R_1 および R_2 が各々、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルおよび $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されているともよく；または

R_1 および R_2 が、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基(これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されているともよい)を表し；

50

R_3 および R_4 が各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキル、アルコキシおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく；または

R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ 、 $C=NOR_a$ 、 $C=C(R_b)(R_c)$ もしくは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）を表し；または

R_2 および R_3 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_5 \sim C_7$ シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく、ならびに、追加的に、環炭素単位は酸素または硫黄原子により置き換えられていてもよい）を表し；

各 R_5 が独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $-C(=NOR_a)C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、ヘテロアリール（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリールオキシ（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）を表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、フェニルおよびヘテロアリール基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、シアノおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～5個の置換基で置換されていてもよく； n は、0、1、2、3または4であり；

R_6 が、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

各 R_7 が独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシもしくは $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシであり； m は、0、1、2、3もしくは4であり；または

2つの隣接する R_7 置換基が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_5 \sim C_7$ シクロアルキル基（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく、ならびに、追加的に、環炭素単位は酸素または硫黄原子により置き換えられていてもよい）を表し；

R_a が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルおよび $C_3 \sim C_6$ アルキニルから選択され、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく；

R_b および R_c が各々、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択され、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい；

式Iの化合物である式IBのもの；

または、その塩もしくはN-オキシドである。

【0062】

本発明に係る化合物の他の好ましい群は、

R_1 および R_2 が各々、水素および $C_1 \sim C_4$ アルキルから独立して選択され、ここで、ア

ルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されているいてもよく；または

R_1 および R_2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されているいてもよい）を表し；

R_3 および R_4 が各々、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルおよび $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されているいてもよく；または

R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ 、 $C=NOR_a$ または $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されているいてもよい）を表し；

各 R_5 が独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ、 $-C(=NOR_a)C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル、ヘテロアリール（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チアゾリルまたはオキサゾリルである）を表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、フェニルおよびヘテロアリール基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキルおよび $C_1 \sim C_3$ アルコキシから独立して選択される1～3個の置換基で置換されているいてもよく； n は、0、1または2であり；

R_6 が水素または $C_1 \sim C_3$ アルキルであり；

各 R_7 が独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルオキシまたは $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシを表し； m は、0、1、2もしくは3であり；または

2つの隣接する R_7 置換基が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_5 \sim C_6$ シクロアルキル基を表し；

R_a が、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキルおよび $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルから選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、任意選択により、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されているいてもよい；

式Iの化合物である式ICのもの、または、その塩もしくはN-オキシドである。

【0063】

本発明に係る化合物の他の好ましい群は、

R_1 および R_2 が各々、水素および $C_1 \sim C_4$ アルキルから独立して選択され、ここで、アルキル基は、任意選択により、ハロゲン、メトキシおよびメチルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されているいてもよく；または

R_1 および R_2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル基（これは、任意選択により、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されているいてもよい）を表し；

R_3 および R_4 が各々、水素、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_4$ アルキルから独立して選択され、ここで、アルキル基は、任意選択により、ハロゲン、メトキシおよびメチルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されているいてもよく；または

R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ 、 $C=NOR_a$ または $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル（これは、任意選択により、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で置換されているいてもよい）を表し；

各 R_5 が独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルま

たはフェニルを表し、ここで、アルキル、シクロアルキルおよびフェニル基は、任意選択により、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_3$ アルキルから独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく； n は0、1または2であり；

R_6 が水素またはメチルであり；

各 R_7 が独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオまたは $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し； m は0、1または2であり；ならびに

R_a が、水素および $C_1 \sim C_4$ アルキルから選択され、ここで、アルキル基は、任意選択により、1～3個のハロゲン原子で置換されていてもよい；

式Iの化合物である式IDのもの、または、その塩もしくはN - オキシドである。

10

【0064】

本発明に係る化合物の他の好ましい群は、 R_1 および R_2 が各々、水素および $C_1 \sim C_3$ アルキルから独立して選択され；または

R_1 および R_2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル基を表し；

R_3 および R_4 が各々、水素、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_3$ アルキルから独立して選択され；または

R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ 、 $C=NO R_a$ または $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し；

各 R_5 が独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルまたはフェニルを表し、ここで、アルキル、シクロアルキルおよびフェニル基は、任意選択により、1～3個のハロゲン原子で置換されていてもよく； n は0、1または2であり；

20

R_6 が水素またはメチルであり；

各 R_7 が独立して、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルまたは $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し； m は0、1または2であり；ならびに

R_a が水素および $C_1 \sim C_3$ アルキルから選択され、ここで、アルキル基は、任意選択により、1～3個のフルオロ原子で置換されていてもよい；

式Iの化合物である式IEのもの、または、その塩もしくはN - オキシドである。

【0065】

本発明に係る化合物の他の好ましい群は、 R_1 および R_2 が各々、水素および $C_1 \sim C_3$ アルキルから独立して選択され；または

30

R_1 および R_2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル基を表し；

R_3 および R_4 が各々、水素、フルオロまたは $C_1 \sim C_3$ アルキルから独立して選択され；または

R_3 および R_4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ もしくは $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し；

各 R_5 が独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを表し、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、任意選択により、1～3個のフルオロ原子で置換されていてもよく； n は0、1または2であり；

40

R_6 が水素であり；ならびに

各 R_7 が独立して、フルオロ、クロロまたは $C_1 \sim C_3$ アルキルを表し； m は1または2である、

式Iの化合物である式IFのもの、または、その塩もしくはN - オキシドである。

【0066】

式Iの化合物の特定の例を以下の表A1～A18に例示する。

表A1は、170種の式I - aの化合物

【表 1 - 1】

項目	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅
1	CH ₃	CH ₃	H	H	H [n=0]
2	CH ₃	CH ₃	H	H	5-F
3	CH ₃	CH ₃	H	H	6-F
4	CH ₃	CH ₃	H	H	7-F
5	CH ₃	CH ₃	H	H	8-F
6	CH ₃	CH ₃	H	H	5-Cl
7	CH ₃	CH ₃	H	H	6-Cl
8	CH ₃	CH ₃	H	H	7-Cl
9	CH ₃	CH ₃	H	H	8-Cl
10	CH ₃	CH ₃	H	H	5-Br
11	CH ₃	CH ₃	H	H	6-Br
12	CH ₃	CH ₃	H	H	5-I
13	CH ₃	CH ₃	H	H	5,6-F ₂
14	CH ₃	CH ₃	H	H	5,6-Cl ₂
15	CH ₃	CH ₃	H	H	5-F-6-Cl
16	CH ₃	CH ₃	H	H	5-CH ₃
17	CH ₃	CH ₃	H	H	6-CH ₃
18	CH ₃	CH ₃	H	H	5-CH ₂ CH ₃
19	CH ₃	CH ₃	H	H	5-シクロプロピル
20	CH ₃	CH ₃	H	H	5-CN
21	CH ₃	CH ₃	H	H	5-OCH ₃
22	CH ₃	CH ₃	H	H	5-OC ₆ H ₅
23	CH ₃	CH ₃	H	H	5-O-(ピリド-2-イル)
24	CH ₃	CH ₃	H	H	5-CF ₃
25	CH ₃	CH ₃	H	H	5-(2-F-C ₆ H ₅)
26	CH ₃	CH ₃	H	H	5-(チアゾール-2-イル)
27	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H [n=0]
28	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	5-F
29	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	H [n=0]
30	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	5-F
31	CH ₃	CH ₃	H	F	H [n=0]
32	CH ₃	CH ₃	H	F	5-F
33	CH ₃	CH ₃	H	F	6-F
34	CH ₃	CH ₃	H	F	5-Cl
35	CH ₃	CH ₃	H	F	6-Cl
36	CH ₃	CH ₃	H	F	5-Br
37	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H [n=0]
38	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F
39	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	6-F
40	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	7-F
41	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	8-F
42	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-Cl

10

20

30

40

【表 1 - 2】

43	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	6-Cl
44	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	7-Cl
45	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	8-Cl
46	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-Br
47	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	6-Br
48	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5,6-F ₂
49	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5,6-Cl ₂
50	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F-6-Cl
51	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-CH ₃
52	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃
53	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-CH ₂ CH ₃
54	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-シクロプロピル
55	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-CN
56	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-OC ₆ H ₅
57	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-O-(ピリド-2-イル)
58	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-CF ₃
59	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-(2-F-C ₆ H ₅)
60	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-(チアゾール-2-イル)
61	CH ₃	CH ₃	=O		H [n=0]
62	CH ₃	CH ₃	=O		5-F
63	CH ₃	CH ₃	=O		6-F
64	CH ₃	CH ₃	=O		5-Cl
65	CH ₃	CH ₃	=O		6-Cl
66	CH ₃	CH ₃	=O		5-Br
67	CH ₃	CH ₃	=O		5-CH ₃
68	CH ₃	CH ₃	=O		5-C ₂ H ₅
69	CH ₃	CH ₃	=O		5-C ₆ H ₅
70	CH ₃	CH ₃	=NOH		H [n=0]
71	CH ₃	CH ₃	=NOH		5-CH ₃
72	CH ₃	CH ₃	=NOH		5-C ₂ H ₅
73	CH ₃	CH ₃	=NOH		5-C ₆ H ₅
74	CH ₃	CH ₃	=NOCH ₃		H [n=0]
75	CH ₃	CH ₃	=NOCH ₃		5-F
76	CH ₃	CH ₃	=NOCH ₃		6-F
77	CH ₃	CH ₃	=NOCH ₃		5-Cl
78	CH ₃	CH ₃	=NOCH ₃		6-Cl
79	CH ₃	CH ₃	=NOCH ₃		5-Br
80	CH ₃	CH ₃	=NOCH ₃		5-CH ₃
81	CH ₃	CH ₃	=NOCH ₃		5-C ₂ H ₅
82	CH ₃	CH ₃	=NOCH ₃		5-C ₆ H ₅
83	CH ₃	CH ₃	F	F	H [n=0]
84	CH ₃	CH ₃	F	F	5-F
85	CH ₃	CH ₃	F	F	6-F

10

20

30

40

【表 1 - 3】

86	CH ₃	CH ₃	F	F	5-Cl
87	CH ₃	CH ₃	F	F	6-Cl
88	CH ₃	CH ₃	F	F	5-Br
89	CH ₃	CH ₃	F	F	5-F-6-Cl
90	CH ₃	CH ₃	F	F	5-CH ₃
91	CH ₃	CH ₃	シクロプロピル		H [n=0]
92	CH ₃	CH ₃	シクロプロピル		5-F
93	CH ₃	CH ₃	シクロプロピル		5-Cl
94	CH ₃	CH ₃	シクロプロピル		5-CH ₃
95	CH ₃	CH ₃	シクロプロピル		5,6-F ₂
96	CH ₃	CH ₃	シクロプロピル		5-F, 6-Cl
97	CH ₃	CH ₃	シクロブチル		H [n=0]
98	CH ₃	CH ₃	シクロブチル		5-F
99	CH ₃	CH ₃	シクロブチル		5-Cl
100	CH ₃	CH ₃	シクロブチル		5-CH ₃
101	CH ₃	CH ₃	シクロブチル		5,6-F ₂
102	CH ₃	CH ₃	シクロブチル		5-F, 6-Cl
103	CH ₃	CH ₃	シクロペンチル		H [n=0]
104	CH ₃	CH ₃	シクロペンチル		5-F
105	H	H	シクロプロピル		H [n=0]
106	H	H	シクロプロピル		5-F
107	H	H	シクロプロピル		5-Cl
108	H	H	シクロプロピル		5-CH ₃
109	H	H	シクロプロピル		5,6-F ₂
110	H	H	シクロプロピル		5-F, 6-Cl
111	H	H	シクロブチル		H [n=0]
112	H	H	シクロブチル		5-F
113	H	H	シクロブチル		5-Cl
114	H	H	シクロブチル		5-CH ₃
115	H	H	シクロブチル		5,6-F ₂
116	H	H	シクロブチル		5-F, 6-Cl
117	H	H	シクロペンチル		H [n=0]
118	H	H	シクロペンチル		5-F
119	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	H [n=0]
120	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	5-F
121	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	5-Cl
122	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	H [n=0]
123	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	5-F
124	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	5-Cl
125	CH ₃	CF ₃	H	H	H [n=0]
126	CH ₃	CF ₃	H	H	5-F
127	CH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H [n=0]
128	CH ₃	CH ₂ Cl	H	H	5-F

10

20

30

40

【表 1 - 4】

129	CH ₃	CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	H [n=0]
130	CH ₃	CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	5-F
131	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H [n=0]
132	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F
133	CH ₃	CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃	H [n=0]
134	CH ₃	CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F
135	CH ₃	H	H	H	H [n=0]
136	CH ₃	H	H	H	5-F
137	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H [n=0]
138	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	5-F
139	シクロプロピル		H	H	H [n=0]
140	シクロプロピル		CH ₃	CH ₃	H [n=0]
141	シクロプロピル		=O		H [n=0]
142	シクロプロピル		F	F	H [n=0]
143	シクロプロピル		シクロプロピル		H [n=0]
144	シクロプロピル		H	H	5-F
145	シクロプロピル		CH ₃	CH ₃	5-F
146	シクロプロピル		=O		5-F
147	シクロプロピル		F	F	5-F
148	シクロプロピル		シクロプロピル		5-F
149	シクロプロピル		H	H	5-Cl
150	シクロプロピル		H	H	5-Br
151	シクロブチル		H	H	H [n=0]
152	シクロブチル		=O		H [n=0]
153	シクロブチル		F	F	H [n=0]
154	シクロブチル		H	H	5-F
155	シクロブチル		=O		5-F
156	シクロブチル		F	F	5-F
157	シクロブチル		H	H	5-Cl
158	シクロブチル		H	H	5-Br
159	シクロペンチル		H	H	H [n=0]
160	シクロペンチル		=O		H [n=0]
161	シクロペンチル		F	F	H [n=0]
162	シクロペンチル		H	H	5-F
163	シクロペンチル		=O		5-F
164	シクロペンチル		F	F	5-F
165	シクロヘキシル		H	H	H [n=0]
166	シクロヘキシル		=O		H [n=0]
167	シクロヘキシル		F	F	H [n=0]
168	シクロヘキシル		H	H	5-F
169	シクロヘキシル		=O		5-F
170	シクロヘキシル		F	F	5-F

表 A 2 は、170 種の式 I a の化合物（式中、 R_7a および R_7b は H であり、 R_6 はメチルであり、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 の値は上記の表 Z 1 に定義されているとおりである）を提供する。

【0069】

表 A 3 は、170 種の式 I a の化合物（式中、 R_7a および R_7b は H であり、 R_6 はクロロであり、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 の値は上記の表 Z 1 に定義されているとおりである）を提供する。

【0070】

表 A 4 は、170 種の式 I a の化合物（式中、 R_6 および R_7b は H であり、 R_7a はメチルであり、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 の値は上記の表 Z 1 に定義されているとおりである）を提供する。

10

【0071】

表 A 5 は、170 種の式 I a の化合物（式中、 R_6 および R_7b は H であり、 R_7a はフルオロであり、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 の値は上記の表 Z 1 に定義されているとおりである）を提供する。

【0072】

表 A 6 は、170 種の式 I a の化合物（式中、 R_6 および R_7b は H であり、 R_7a はクロロであり、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 の値は上記の表 Z 1 に定義されているとおりである）を提供する。

【0073】

20

表 A 7 は、170 種の式 I a の化合物（式中、 R_6 および R_7b は H であり、 R_7a はエチルであり、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 の値は上記の表 Z 1 に定義されているとおりである）を提供する。

【0074】

表 A 8 は、170 種の式 I a の化合物（式中、 R_6 および R_7b は H であり、 R_7a はブromoであり、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 の値は上記の表 Z 1 に定義されているとおりである）を提供する。

【0075】

表 A 9 は、170 種の式 I a の化合物（式中、 R_6 は H であり、 R_7a および R_7b はメチルであり、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 の値は上記の表 Z 1 に定義されているとおりである）を提供する。

30

【0076】

表 A 10 は、170 種の式 I a の化合物（式中、 R_6 は H であり、 R_7a および R_7b はクロロであり、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 の値は上記の表 Z 1 に定義されているとおりである）を提供する。

【0077】

表 A 11 は、170 種の式 I a の化合物（式中、 R_6 は H であり、 R_7a はメチルであり、 R_7b はクロロであり、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 の値は上記の表 Z 1 に定義されているとおりである）を提供する。

【0078】

40

表 A 12 は、170 種の式 I a の化合物（式中、 R_6 は H であり、 R_7a はフルオロであり、 R_7b はメチルであり、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 の値は上記の表 Z 1 に定義されているとおりである）を提供する。

【0079】

表 A 13 は、170 種の式 I a の化合物（式中、 R_6 は H であり、 R_7a はフルオロであり、 R_7b はクロロであり、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 の値は上記の表 Z 1 に定義されているとおりである）を提供する。

【0080】

表 A 14 は、170 種の式 I a の化合物（式中、 R_6 は H であり、 R_7a はメチルであり、 R_7b はフルオロであり、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 の値は上記の表 Z 1

50

に定義されているとおりである)を提供する。

【0081】

表A15は、170種の式Iaの化合物(式中、 R_6 はHであり、 R_{7a} はクロロであり、 R_{7b} はメチルであり、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 の値は上記の表Z1に定義されているとおりである)を提供する。

【0082】

表A16は、170種の式Iaの化合物(式中、 R_6 はHであり、 R_{7a} はクロロであり、 R_{7b} はフルオロであり、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 の値は上記の表Z1に定義されているとおりである)を提供する。

【0083】

表A17は、170種の式Iaの化合物(式中、 R_6 はHであり、 R_{7a} および R_{7b} は $-CH_2CH_2CH_2-$ であり、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 の値は上記の表Z1に定義されているとおりである)を提供する。

【0084】

表A18は、170種の式Iaの化合物(式中、 R_6 および R_{7a} はHであり、 R_{7b} はメチルであり、ならびに、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 の値は上記の表Z1に定義されているとおりである)を提供する。

【0085】

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

【0086】

本発明の化合物は以下のスキームに示されているとおり形成可能であり、ここで、別段の定めがある場合を除き、各可変項の定義は、式(I)の化合物について上記に定義されているとおりである。

【0087】

式Iの化合物(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、mおよびnは式Iの化合物に定義されているとおりである)は、式IIIの化合物(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 およびnは式Iの化合物に定義されているとおりであり、ならびに、Halはハロゲン、好ましくはクロロまたはブロモである)を伴う、トリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン、ピリジンもしくは2,6-ルチジンなどの有機塩基の存在下、または、銅(I)アセチルアセトネートまたは臭化銅(I)-1,10-フェナントロリン錯体などの銅系触媒、ジクロロ(1,3-ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパン)ニッケルなどのニッケル触媒、または、クロロ(2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2',4',6'-トリイソプロピル-1,1'-ビフェニル)[2-(2'-アミノ-1,1'-ビフェニル)]パラジウム(II)、X-Phosアミノビフェニル塩化パラジウムプレ触媒もしくは[1,3-ビス(2,6-ジイソプロピルフェニル)イミダゾール-2-イリデン](3-クロロピリジル)パラジウム(II)ジクロリドなどのパラジウム系触媒などの遷移金属触媒の存在下、ピリジン、トルエンまたはN,N-ジメチルホルムアミドなどの非プロトン性溶剤中における加熱を伴う、式IIの化合物(式中、 R_6 、 R_7 およびmは式Iの化合物に定義されているとおりである)の変換により得ることが可能である。これをスキーム1に示す。

10

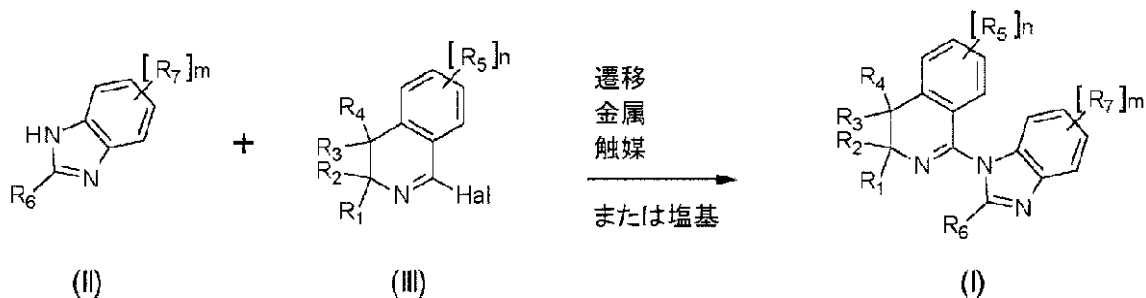
20

30

40

【化4】

スキーム1



10

【0088】

式IIの化合物（式中、 R_6 、 R_7 および m は式Iの化合物に定義されているとおりである）は、市販されているか、または、文献に記載されているとおり当業者に公知である方法を用いて容易に調製される（Grimmet, M. R. In Imidazole and Benzimidazole Synthesis; Meth-Cohn, Katritzky, Eds.; Elsevier Science: Oxford, 1997）。

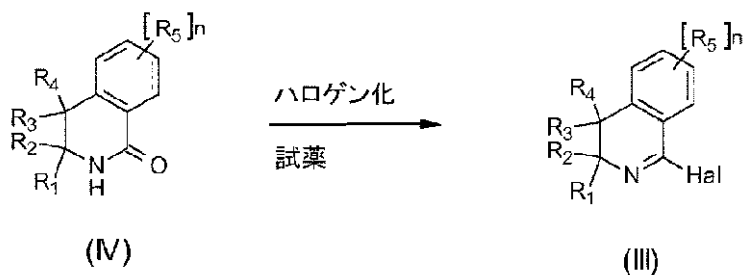
【0089】

式IIIの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりであり、 Hal はハロゲン、好ましくはクロロまたはブロモである）は、オキシ塩化リン、オキシ臭化リン、塩化チオニル、臭化チオニルもしくはヴィルスマイヤー試薬などのハロゲン化試薬をそのまま伴う、または、ジクロロメタンなどの溶剤の存在下における、冷却～加熱の範囲の種々の温度での、式IVの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）の変換により得ることが可能である。これをスキーム2に示す。

20

【化5】

スキーム2



30

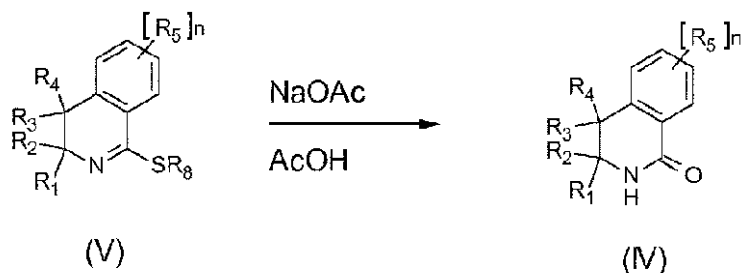
【0090】

式IVの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）は、文献（Yu. B. Vikharev et al. Pharmaceutical Chemistry Journal, 2005, 39, 405-408）に記載されているとおり、酢酸ナトリウムを伴う酢酸中における式Vの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりであり、 R_8 は $C_1 \sim C_6$ アルキルである）の変換により得ることが可能である。これをスキーム3に示す。

40

【化6】

スキーム3



10

【0091】

あるいは、式IIIの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりであり、ならびに、Halはハロゲン、好ましくはクロロまたはブromoである）は、文献（Taeb Sim et al. Tetrahedron Letters, 2010, 51, 4609）に記載されているとおり、塩化スルフルなどのハロゲン化試薬を伴う式Vの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりであり、 R_8 は $C_1 \sim C_6$ アルキルである）の変換により得ることが可能である。これをスキーム4に示す。

20

【化7】

スキーム4



30

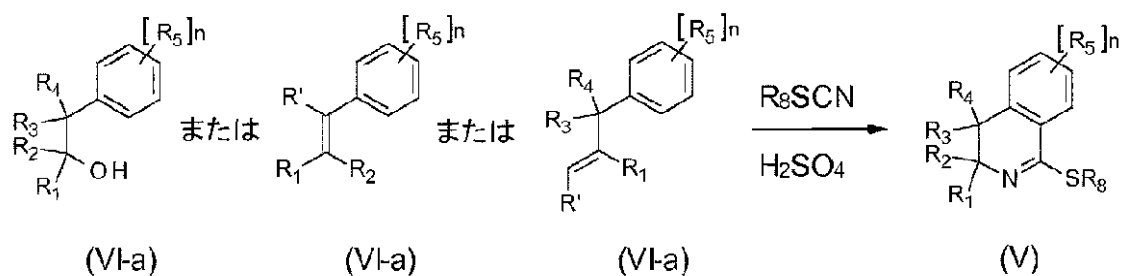
【0092】

式Vの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりであり、 R_8 は $C_1 \sim C_6$ アルキルである）は、文献（Yu. B. Vikhar et al. Pharmaceutical Chemistry Journal, 2005, 39, 405 - 408）に記載されているとおり、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオシアネートを伴う、例えば硫酸による酸性条件下における式VI-a、VI-bまたはVI-cの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりであり、 R' はHまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである）の変換により得ることが可能である。これをスキーム5に示す。

40

【化 8】

スキーム5



10

【0093】

式VI-a、VI-bまたはVI-cの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりであり、 R' はHまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである）は、市販されているか、または、当業者に公知である方法を用いて容易に調製される。

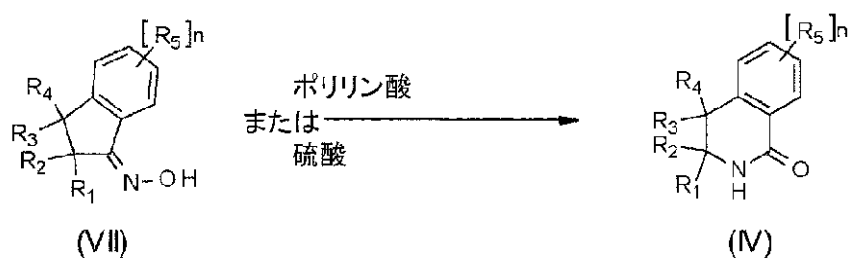
【0094】

あるいは、式VIIの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）は、文献（Jun-ichi Minamikawa, Bioorganic & Medicinal Chemistry, 2003, 11, 2205 - 2209）に記載されているとおり、例えば硫酸またはポリリン酸による酸性条件下における、式VIIIの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）の変換により得ることが可能である。これをスキーム6に示す。

20

【化 9】

スキーム6



30

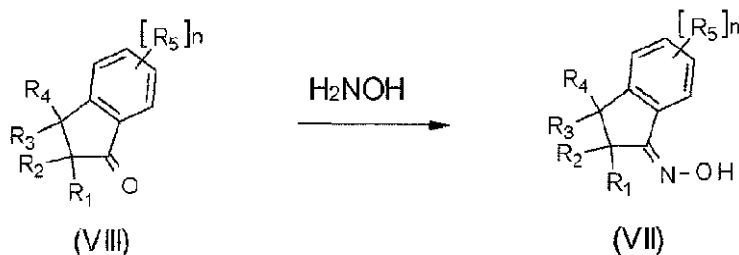
【0095】

式VIIIの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）は、エタノールまたはピリジンなどの溶剤中における、酢酸ナトリウムなどの塩基の存在下または不在下、周囲温度～加熱の範囲の温度でのヒドロキシルアミンまたは塩酸ヒドロキシルアミンを伴う処理による、式IXの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）の変換により得ることが可能である。これをスキーム7に示す。

40

【化10】

スキーム7



10

【0096】

式VIIの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）は、市販されているか、または、当業者に公知である方法を用いて容易に調製される。

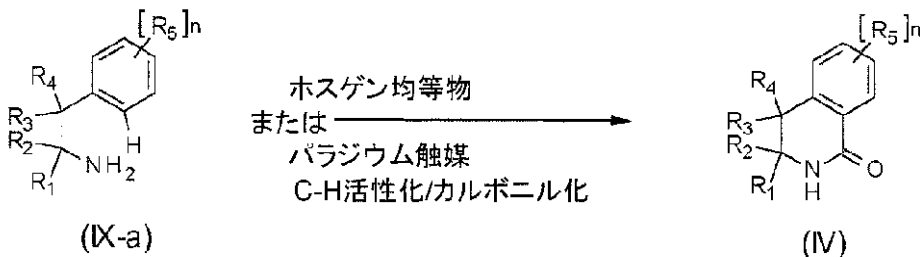
【0097】

あるいは、式IVの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）は、文献（Jaume Graneli et al. Chem. Commun., 2011, 47, 1054 - 1056）において報告されているとおり、ホスゲン、トリホスゲンもしくはカルボニルジイミダゾールなどのカルボニル化剤を伴う処理、および、その後の加熱、または、一酸化炭素ガス、酢酸パラジウムなどのパラジウム触媒およびベンゾキノンなどの酸化剤の存在下における直接触媒C-H活性化-カルボニル化の利用による、式IX-aの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）の変換により得ることが可能である。これをスキーム8に示す。

20

【化11】

スキーム8



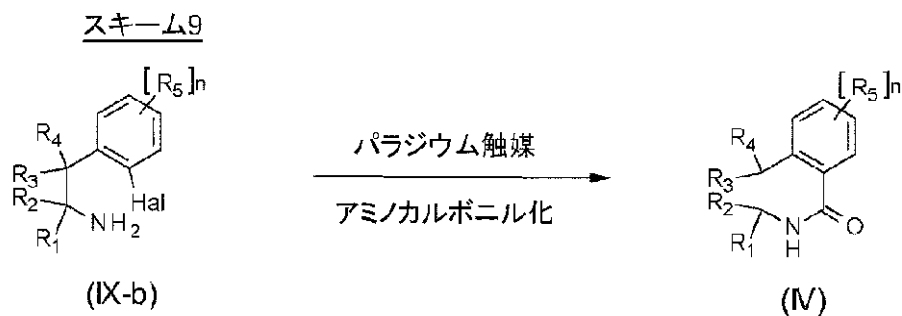
30

【0098】

あるいは、式IVの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）は、文献（Ruimao Hua et al. Tetrahedron Letters, 2013, 54, 5159 - 5161）に報告されているとおり、一酸化炭素ガス、ジクロロビス（トリシクロヘキシルホスフィン）パラジウム（II）もしくはジクロロビス（トリフェノールホスフィン）パラジウム（II）などのパラジウム触媒およびトリエチルアミン、ピロリジンなどの有機塩基または炭酸セシウムもしくは炭酸カリウムなどの無機塩基の存在下における分子内アミノカルボニル化の利用による、式IX-bの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりであり、Halは、ハロゲン、好ましくはクロロ、プロモまたはヨードである）の変換により得ることが可能である。これをスキーム9に示す。

40

【化 1 2】



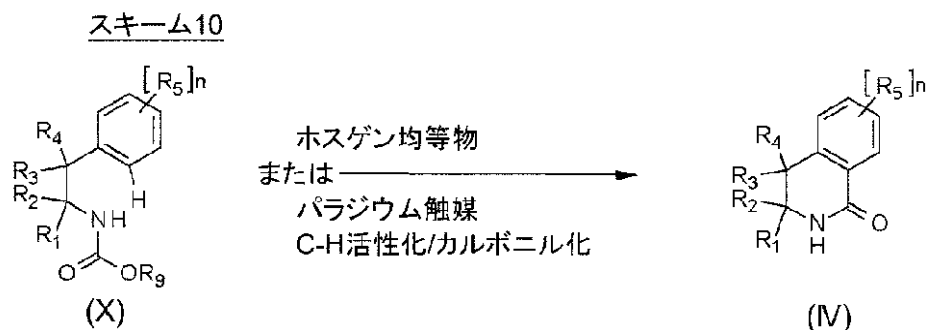
10

【0099】

あるいは、式IVの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）は、文献（Tomohiko Ohwada et al. Journal of Organic Chemistry, 2012, 77, 9313）に記載されているとおり、例えば硫酸またはトリフリク酸による酸性条件下における、式Xの化合物（式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりであり、 R_9 は $C_1 \sim C_6$ アルキルである）の変換により得ることが可能である。これをスキーム10に示す。

【化 1 3】

20



30

【0100】

式I-bの化合物（式中、 R_3 および R_4 はフルオロであり、 R_1 、 R_2 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は式Iの化合物に定義されているとおりである）は、三フッ化ジエチルアミノ硫黄（DAST）もしくは2,2-ジフルオロ-1,3-ジメチル-イミダゾリジン（DFI）などのフッ素化試薬をそのまま、または、溶剤の存在下において伴い、加熱を伴う、式I-cの化合物（式中、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C=O$ を表し、 R_1 、 R_2 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は、式Iに定義されているとおりである）の変換により得ることが可能である。これをスキーム11に示す。

【化 1 4】

スキーム11



10

【 0 1 0 1】

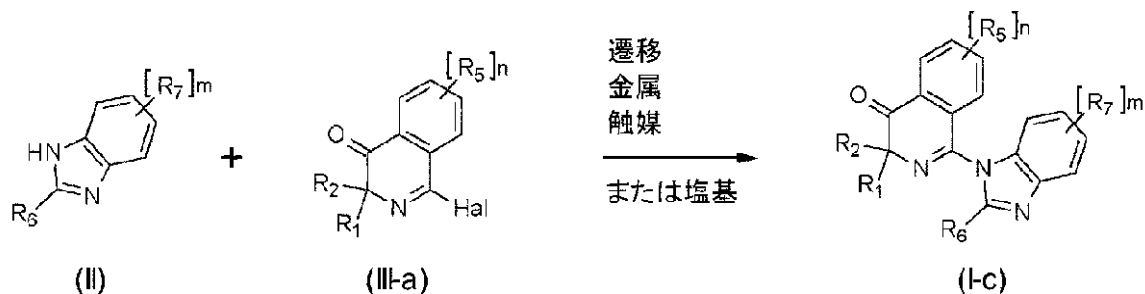
式 I - c の化合物（式中、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒に
 なって、 $C=O$ を表し、 R_1 、 R_2 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は式 I に定義されていると
 おりである）は、式 III - a の化合物（式中、 R_3 および R_4 は、これらが結合している
 炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ を表し、 R_1 、 R_2 、 R_5 および n は式 I に定義されてい
 るとおりであり、 Hal は、ハロゲン、好ましくはクロロまたはブromoである）を伴う、
 トリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン、ピリジンもしくは 2, 6 - ルチジンな
 どのヒンダード有機塩基の存在下、または、銅（I）アセチルアセトネートもしくは臭化
 銅（I）- 1, 10 - フェナントロリン錯体などの銅系触媒、ジクロロ（1, 3 - ビス（
 ジフェニルホスフィノ）プロパン）ニッケルなどのニッケル触媒、もしくは、クロロ（2
 - ジシクロヘキシルホスフィノ - 2', 4', 6' - トリイソプロピル - 1, 1' - ビフ
 ェニル）[2 - （2' - アミノ - 1, 1' - ビフェニル）] パラジウム（II）、 $X - Phos$ アミノ
 ビフェニル塩化パラジウムプレ触媒もしくは [1, 3 - ビス（2, 6 - ジイ
 ソプロピルフェニル）イミダゾール - 2 - イリデン] （3 - クロロピリジル）パラジウム
 （II）ジクロリドなどのパラジウム系触媒などの遷移金属触媒の存在下、ピリジン、ト
 ルエンまたは N, N - ジメチルホルムアミドなどの非プロトン性溶剤中における加熱を伴
 う、式 II の化合物（式中、 R_6 、 R_7 および m は式 I の化合物に定義されているとおりで
 ある）の変換により得ることが可能である。これをスキーム 12 に示す。

20

30

【化 1 5】

スキーム12



40

【 0 1 0 2】

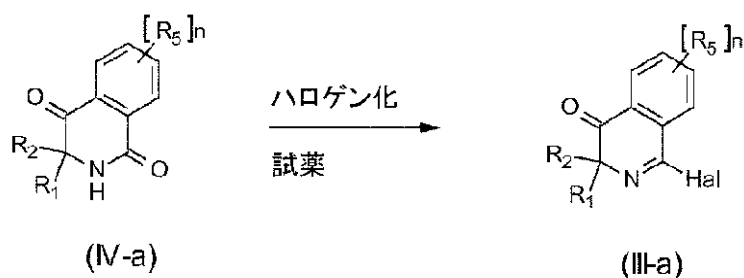
式 III - a の化合物（式中、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒に
 になって、 $C=O$ を表し、 R_1 、 R_2 、 R_5 および n は式 I に定義されているとおりであり
 Hal は、ハロゲン、好ましくはクロロまたはブromoである）は、オキシ塩化リン、オ
 キシ臭化リン、塩化チオニル、臭化チオニルもしくはヴィルスマイヤー試薬などのハロゲ
 ン化試薬をそのまま伴う、または、ジクロロメタンなどの溶剤の存在下における、冷却～

50

加熱の範囲の種々の温度での、式ⅠⅤ-aの化合物（式中、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C=O$ を表し、 R_1 、 R_2 、 R_5 および n は式Ⅰに定義されているとおりである）の変換により得ることが可能である。これをスキーム13に示す。

【化16】

スキーム13



10

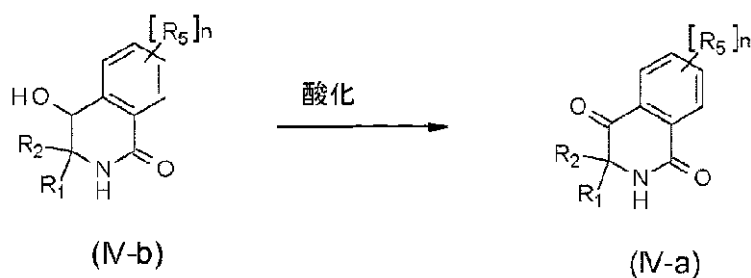
【0103】

式ⅠⅤ-aの化合物（式中、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C=O$ を表し、 R_1 、 R_2 、 R_5 および n は式Ⅰに定義されているとおりである）は、1, 1, 1-トリアセトキシ-1, 1-ジヒドロ-1, 2-ベンズヨードキソール3(1H)-オン（デス・マーチン・ペルヨージナン）などの酸化剤を伴う、または、塩化オキサリル、ジメチルスルホキシド（DMSO）およびトリエチルアミンなどの有機塩基（スワーン酸化）を用いる、式ⅠⅤ-bの化合物（式中、 R_3 は水素を表し、 R_4 はOHを表し、 R_1 、 R_2 、 R_5 および n は式Ⅰに定義されているとおりである）の変換により得ることが可能である。これをスキーム14に示す。

20

【化17】

スキーム14



30

【0104】

式ⅠⅤ-bの化合物（式中、 R_3 は水素を表し、 R_4 はOHを表し、 R_1 、 R_2 、 R_5 および n は式Ⅰに定義されているとおりである）は、テトラヒドロフランまたは1, 4-ジオキサンなどの有機溶剤と水との混合物中における加熱などの加水分解条件下における、塩酸などの無機酸もしくは炭酸水素ナトリウムなどの無機塩基の存在下または不在下、周囲温度～加熱の範囲の温度での、式ⅠⅤ-cの化合物（式中、 R_3 は水素を表し、 R_4 はHalを表し、ここで、Halはハロゲン、好ましくはクロロまたはブロモであり、 R_1 、 R_2 、 R_5 および n は式Ⅰに定義されているとおりである）の変換により得ることが可能である。これをスキーム15に示す。

40

【化 18】

スキーム15



10

【0105】

式IV-cの化合物(式中、 R_3 は水素を表し、 R_4 はHalを表し、ここで、Halはハロゲン、好ましくはクロロまたはブromoであり、 R_1 、 R_2 、 R_5 およびnは式Iに定義されているとおりである)は、文献(Jahangir et al Journal of Organic Chemistry, 1989, 54, 2992)に記載されているとおり、N-クロロスクシンイミド(NCS)、N-ブromosクシンイミド(NBS)または1,3-ジブromo-5,5-ジメチルヒダントインなどのハロゲン化剤を伴う、過酸化ベンゾイルまたはアゾビスイソブチロニトリル(AIBN)などのラジカル開始剤の存在下における、式IV-dの化合物(式中、 R_3 および R_4 は水素を表し、 R_1 、 R_2 、 R_5 およびnは式Iに定義されているとおりである)の変換により得ることが可能である。これをスキーム16に示す。

20

【化 19】

スキーム16



30

【0106】

あるいは、式IV-aの化合物(式中、 R_3 および R_4 は、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C=O$ を表し、 R_1 、 R_2 、 R_5 およびnは式Iに定義されているとおりである)は、テトラヒドロフランまたは1,4-ジオキサンなどの有機溶剤と水との混合物中における加熱などの加水分解条件下における、塩酸などの無機酸もしくは炭酸水素ナトリウムなどの無機塩基の存在下または不在下、周囲温度~加熱の範囲の温度での、式IV-eの化合物(式中、 R_3 および R_4 はHalを表し、ここで、Halはハロゲン、好ましくはクロロまたはブromoであり、 R_1 、 R_2 、 R_5 およびnは式Iに定義されているとおりである)の変換により得ることが可能である。これをスキーム17に示す。

40

【化20】

スキーム17



10

【0107】

式IV-eの化合物(式中、 R_3 および R_4 はHalを表し、ここで、Halはハロゲン、好ましくはクロロまたはブromoであり、 R_1 、 R_2 、 R_5 およびnは式Iに定義されているとおりである)は、文献(Jahangir et al Journal of Organic Chemistry, 1989, 54, 2992)に記載されているとおり、N-クロロスクシンイミド(NCS)、N-ブromosクシンイミド(NBS)または1,3-ジブromo-5,5-ジメチルヒダントインなどのハロゲン化剤を伴う、過酸化ベンゾイルまたはアゾビスイソブチロニトリル(AIBN)などのラジカル開始剤の存在下における、式IV-dの化合物(式中、 R_3 および R_4 は水素を表し、 R_1 、 R_2 、 R_5 およびnは式Iに定義されているとおりである)の変換により得ることが可能である。これをスキーム18に示す。

20

【化21】

スキーム18



30

【0108】

式IV-dの化合物は、スキーム3に記載の方法に従って入手することが可能である。

【0109】

あるいは、式I-aの化合物(式中、 R_3 および R_4 はフルオロであり、 R_1 、 R_2 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、mおよびnは式Iの化合物に定義されているとおりである)は、式III-bの化合物(式中、 R_3 および R_4 はフルオロであり、 R_1 、 R_2 、 R_5 およびnは式Iに定義されているとおりであり、Halは、ハロゲン、好ましくはクロロまたはブromoである)を伴う、トリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン、ピリジンもしくは2,6-ルチジンなどのヒンダード有機塩基の存在下、または、銅(I)アセチルアセトネートまたは臭化銅(I)-1,10-フェナントロリン錯体などの銅系触媒、ジクロロ(1,3-ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパン)ニッケルなどのニッケル触媒、または、クロロ(2-ジクロヘキシルホスフィノ-2',4',6'-トリイソプロピル-1,1'-ピフェニル)[2-(2'-アミノ-1,1'-ピフェニル)]パラジウム(II)、X-Phosアミノピフェニル塩化パラジウム触媒もしくは[1,3-ビス(2,6-ジイソプロピルフェニル)イミダゾール-2-イリデン](3-クロロピリジル)パラ

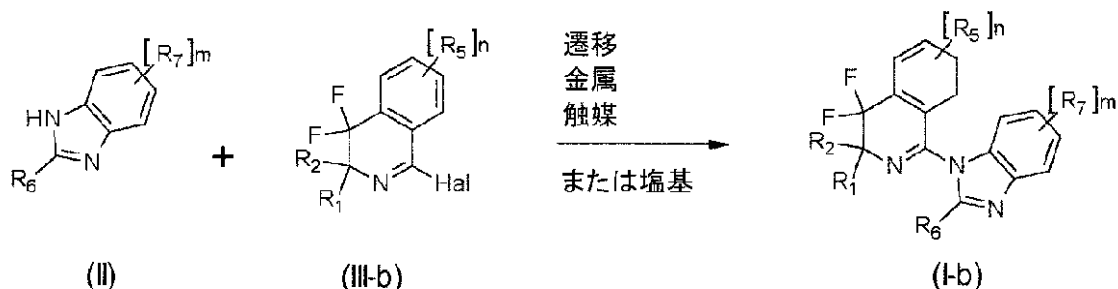
40

50

ジウム (II) ジクロリドなどのパラジウム系触媒などの遷移金属触媒の存在下、ピリジン、トルエンまたはN, N - ジメチルホルムアミドなどの非プロトン性溶剤中における加熱を伴う、式IIの化合物 (式中、 R_6 、 R_7 および m は式Iの化合物に定義されているとおりである) の変換により得ることが可能である。これをスキーム19に示す。

【化22】

スキーム19



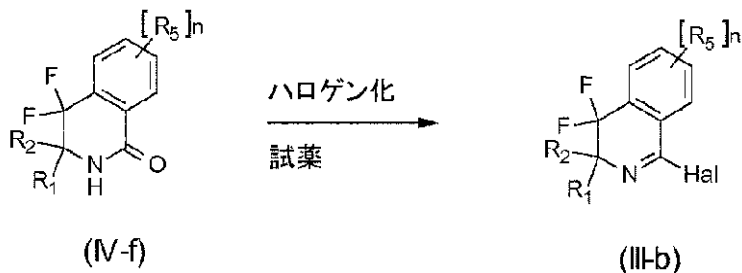
10

【0110】

式III-bの化合物 (式中、 R_3 および R_4 はフルオロであり、 R_1 、 R_2 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりであり、Halは、ハロゲン、好ましくはクロロまたはブromoである) は、オキシ塩化リン、オキシ臭化リン、塩化チオニル、臭化チオニルもしくはヴィルスマイヤー試薬などのハロゲン化試薬をそのまま伴う、または、ジクロロメタンなどの溶剤の存在下における、冷却～加熱の範囲の種々の温度での、式IV-fの化合物 (式中、 R_3 および R_4 はフルオロであり、 R_1 、 R_2 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである) の変換により得ることが可能である。これをスキーム20に示す。

【化23】

スキーム20



30

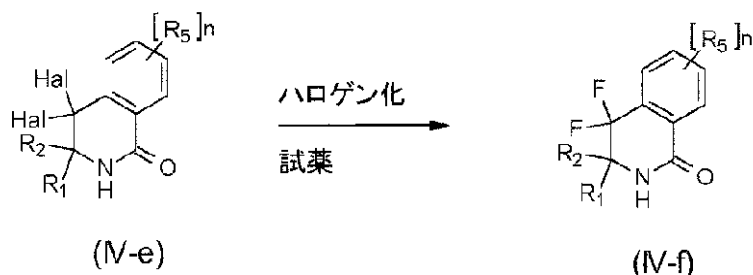
【0111】

式IV-fの化合物 (式中、 R_3 および R_4 はフルオロであり、 R_1 、 R_2 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである) は、文献 (梅谷豪毅ら、国際公開第2013047749号) に記載されているとおり、フッ化カリウム、フッ化セシウムまたはフッ化水素などのフッ化物源を伴うピリジンまたはトリエチルアミンなどの有機塩基の存在下における、式IV-eの化合物 (式中、 R_3 および R_4 はHalであり、Halはハロゲン、好ましくはクロロまたはブromoであり、 R_1 、 R_2 、 R_5 および n は式Iの化合物に定義されているとおりである) の変換により得ることが可能である。これをスキーム21に示す。

40

【化24】

スキーム21



10

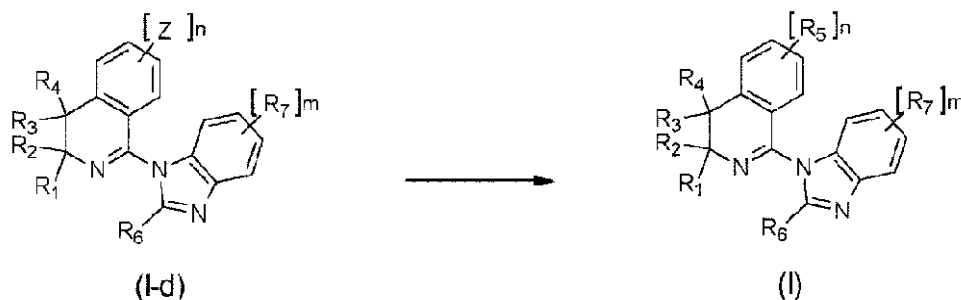
【0112】

あるいは、式Iの化合物(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は式Iに定義されているとおりである)は、溶剤中、塩基の存在下または不在下、ならびに、カップリング試薬および金属触媒の存在下における、式I-dの化合物(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_6 、 R_7 、 m および n は式Iに定義されているとおりであり、 Z は臭素またはヨウ素を表す)の変換により得ることが可能である。カップリング剤、触媒、溶剤および塩基は、“Cross-Coupling Reactions: A Practical Guide (Topics in Current Chemistry)”, edited by Norio Miyaura und S. L. Buchwald (editions Springer)、または、“Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions”, edited by Armin de Meijere and Francois Diederich (editions WILEY-VCH)に記載のものなどの通常のカップリング反応に用いられるものである限り、特に限定されない。これをスキーム22に示す。

20

【化25】

スキーム22



30

【0113】

あるいは、式Iの化合物(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 m および n は式Iに定義されているとおりである)は、溶剤中、塩基の存在下または不在下、ならびに、カップリング試薬および金属触媒の存在下における、式I-eの化合物(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 m および n は式Iに定義されているとおりであり、 Y は臭素またはヨウ素を表す)の変換により得ることが可能である。カップリング剤、触媒、溶剤および塩基は特に限定されず、“Cross-Coupling Reactions: A Practical Guide (Topics in Current Chemistry)”, edited by Norio Miyaura und S. L. Buchwald (editions Springer)、または、“Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions”, edited by Armin de Meijere and Francois Diederich (editions WILEY-VCH)に記載のものなどの通常のカップリ

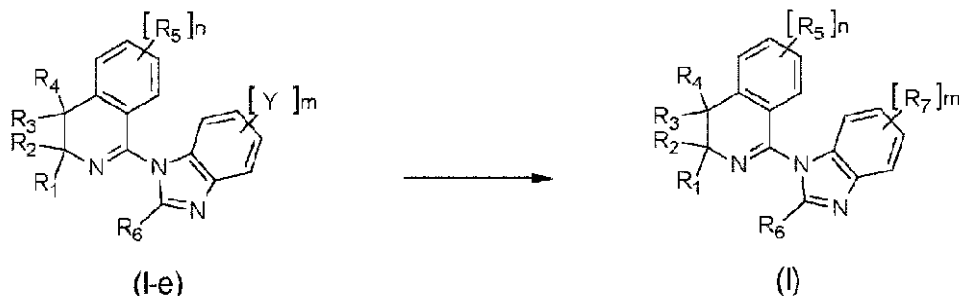
40

50

ング反応において用いられるものである。これはスキーム 23 に示されている。

【化 26】

スキーム 23



10

【0114】

あるいは、一定の式 I の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 m および n は上記に定義されているとおりである）は、他の関連性の高い式 I（またはその類似体）の化合物の当業者に公知である標準的な合成技術を用いる変換により得ることが可能である。網羅的ではないが、例としては、酸化反応、還元反応、加水分解反応、カップリング反応、芳香族求核性または求電子性置換反応、求核置換反応、求核性付加反応およびハロゲン化反応が挙げられる。

20

【0115】

上記のスキームに記載の一定の中間体は新規のものであり、従って、本発明のさらなる態様を構成する。

【0116】

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

30

【0117】

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

40

【0118】

菌類による感染症、ならびに、土壤中で発生する植物病原性菌類に対する保護のために、例えば果実、塊茎もしくは穀粒などの種子または植物挿穂（例えばイネ）といった植物繁殖体を処理する粉衣剤として式 I の化合物を用いることも可能である。この繁殖体は、植え付け前に式 I の化合物を含む組成物で処理することが可能である：例えば、種子は、播種される前に粉衣されることが可能である。式 I の化合物はまた、種子を液体配合物に含浸させるか、または、種子を固体配合物でコーティングすることにより穀粒に適用（コーティング）することが可能である。組成物はまた、繁殖体が植え付けられる際に植え付け箇所に適用が可能であり、例えば、播種の最中において蒔き溝に適用が可能である。

50

本発明はまた、このような植物繁殖体の処理方法、および、このようにして処理された植物繁殖体にも関する。

【0119】

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

【0120】

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

【0121】

これらを含む式 I の化合物および殺菌性組成物を用いて、広範囲の真菌性植物病原体によって引き起こされる植物病害を防除し得る。これらは、観賞用作物、芝生、野菜、農作物、穀類および果実作物の葉病原体などの広範囲の植物病害の防除において効果的である。

【0122】

防除され得る、これらの病害に係る菌類および菌類媒介物、ならびに、植物病原性バクテリアおよびウイルスは、例えば以下のとおりである。

アブシジアコリムピフェラ (*Absidia corymbifera*)、アルテルナリア属の一種 (*Alternaria* spp)、アフアノミセス属の一種 (*Aphanomyces* spp)、アスコキタ属の一種 (*Ascochyta* spp)、A. フラバス (*A. flavus*)、A. フミガーツス (*A. fumigatus*)、A. ニズランス (*A. nidulans*)、A. ニガー (*A. niger*)、A. テルス (*A. terrus*) を含むアスペルギルス属の一種 (*Aspergillus* spp.)、A. プルランス (*A. pullulans*) を含むアウレオバシジウム属の一種 (*Aureobasidium* spp.)、ブラストミセスデルマチチデイス (*Blastomyces dermatitidis*)、ブルメリアグラミニス (*Blumeria graminis*)、ブレミアラクツカエ (*Bremia lactucae*)、B. ドチデア (*B. dothidea*)、B. オブツサ (*B. obtusa*) のボトリオスファエリア属の一種 (*Botryosphaeria* spp.)、B. シネレア (*B. cinerea*) を含むボトリチス属の一種 (*Botrytis* spp.)、C. アルビカンス (*C. albicans*)、C. グラブラータ (*C. glabrata*)、C. クルセイ (*C. krusei*)、C. ルシタニエ (*C. lusitaniae*)、C. パラブシロシス (*C. parapsilosis*)、C. トロピカリス (*C. tropicalis*) のカンジダ属の一種 (*Candida* spp.)、セファロアスクスフラグラン (*Cephaloascus fragrans*)、セラトシスチス属の一種 (*Ceratocystis* spp)、C. アラキジコラ (*C. arachidicola*) を含むセルコスボラ属の一種 (*Cercospora* spp.)、セルコスボリジウムペルソナツム (*Cercosporidium personatum*)、クラドスポリウム属の一種 (*Cladosporium* spp)、クラビセプスプルブレア (*Claviceps purpurea*)、

コクシジオイデスイミティス (*Coccidioides immitis*)、コクリオボルス属の一種 (*Cochliobolus* spp)、C. ムサエ (*C. musae*) を含むコレトトリカム属の一種 (*Colletotrichum* spp.)、

クリプトコッカスネオフォルマンス (*Cryptococcus neoformans*)、ジアボルテ属の一種 (*Diaporthe* spp)、ジディメラ属の一種 (*Didymella* spp)、ドレックスレラ属の一種 (*Drechslera* spp)、エルシノエ属の一種 (*Elsinoe* spp)、

エピデルモフィトン属の一種 (*Epidermophyton* spp)、エルウィニアアミロボラ (*Erwinia amylovora*)、E. シコラセアルム (*E. chioracearum*) を含むエリシフェ種 (*Erysiphe* spp.)、

10

20

30

40

50

ユーチパラタ (*Eutypa lata*)、*F. クルモルム* (*F. culmorum*)、*F. グラミネアルム* (*F. graminearum*)、*F. ラングセチエ* (*F. langsethiae*)、*F. モニリホルメ* (*F. moniliforme*)、*F. オキシスポルム* (*F. oxysporum*)、*F. プロリフェラツム* (*F. proliferatum*)、*F. スブグルチナンス* (*F. subglutinans*)、*F. ソラニ* (*F. solani*) を含む *フザリウム* 属の一種 (*Fusarium spp.*)、*ゲーウマノミセスグラミニス* (*Gaeumannomyces graminis*)、*ギベレラフジクロイ* (*Gibberella fujikuroi*)、*グロエオデスポミゲナ* (*Gloeodes pomigena*)、*グロエオスポリウムムサルム* (*Gloeosporium musarum*)、*グロメラシングレート* (*Glomerella cingulate*)、*ガイグナルディアビドウェリイ* (*Guignardia bidwellii*)、*ギムノスポランギウム ジュニペリ-ヴィルギニアネ* (*Gymnosporangium juniperi-virginianae*)、*ヘルミントスポリウム* 属の一種 (*Helminthosporium spp.*)、*ヘミレイア* 属の一種 (*Hemileia spp.*)、*H. カプスラツム* (*H. capsulatum*) を含む *ヒストプラズマ* 属の一種 (*Histoplasma spp.*)、*ラエチサリアフシホルミス* (*Laetisaria fuciformis*)、*レプトグラフィウムリンドベルギ* (*Leptographium lindbergi*)、*レveilラタウリカ* (*Leveillula taurica*)、*ロフォデルミウムセディチオスム* (*Lophodermium seditiosum*)、*コムギ赤かび病菌* (*Microdochium nivale*)、*ミクロスボルム* 属の一種 (*Microsporum spp.*)、*モニリニア* 属の一種 (*Monilinia spp.*)、*ムコール* 属の一種 (*Mucor spp.*)、*コムギ葉枯病菌* (*M. graminicola*)、*M. ポミ* (*M. pomi*) を含む *ミコスファエレラ* 属の一種 (*Mycosphaerella spp.*)、*オンコバシジウムテオブロマエオン* (*Oncobasidium theobromaeon*)、*オフィオストマピセエ* (*Ophiostoma piceae*)、*パラコジディオイデス* 属の一種 (*Paracoccidioides spp.*)、*P. ディジタツム* (*P. digitatum*)、*P. イタリクム* (*P. italicum*) を含む *ペニシリウム* 属の一種 (*Penicillium spp.*)、*ペトリエリジウム* 属の一種 (*Petriellidium spp.*)、*P. メイディス* (*P. maydis*)、*P. フィリピンシス* (*P. philippinensis*) および *P. ソルギ* (*P. sorghi*) を含む *ペロノスクレロスポラ* 属の一種 (*Peronosclerospora spp.*)、*ペロノスポラ* 属の一種 (*Peronospora spp.*)、*コムギふ枯病菌* (*Phaeosphaeria nodorum*)、*ファコプソラパチリジ* (*Phakopsora pachyrhizi*)、*フェリヌスイグニアルス* (*Phellinus igniarius*)、*フィアロフォラ* 属の一種 (*Phialophora spp.*)、*フォーマ* 属の一種 (*Phoma spp.*)、*ホモプシスピティコーラ* (*Phomopsis viticola*)、*P. インフェスタンス* (*P. infestans*) を含む *フィトフトラ* 属の一種 (*Phytophthora spp.*)、*P. ハルステジイ* (*P. halstedii*)、*P. ビチコーラ* (*P. viticola*) を含む *プラスモパラ* 属の一種 (*Plasmopara spp.*)、*プレオスポラ* 属の一種 (*Pleospora spp.*)、*リンゴうどんこ病菌* (*P. leucotricha*) を含む *ポドスファエラ* 属の一種 (*Podosphaera spp.*)、*ポリミキサグラミニス* (*Polymyxa graminis*)、*ポリミキサベタエ* (*Polymyxa betae*)、*シュードセルコスボレラヘルポトリコイド* (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、*シュードモナス* 属の一種 (*Pseudomonas spp.*)、*P. クベンシス* (*P. cubensis*)、*P. フムリ* (*P. humuli*) を含む *シュードペロノスポラ* 属の一種 (*Pseudoperonospora spp.*)、*シュードペジザトラケイフィラ* (*Pseudopeziza tracheiphila*)、*P. ホルデイ* (*P. hordei*)、*P. レコンディタ* (*P. recondita*)、*P. ストリイホルミス* (*P. stri*

10

20

30

40

50

i formis)、P.トリチシナ(P. trititcina)を含むブッシニア属の一種(Puccinia spp.)、ピレノベジザ属の一種(Pyrenopeziza spp.)、ピレノフォラ属の一種(Pyrenophora spp.)、イネいもち病菌(P. oryzae)を含むピリクラリア属の一種(Pyricularia spp.)、P.ウルチムム(P. ultimum)を含むピシウム属の一種(Pythium spp.)、ラムラリア属の一種(Ramularia spp.)、リゾクトニア属の一種(Rhizoctonia spp.)、リゾムコールプシルス(Rhizomucor pusillus)、リゾプスアリスス(Rhizopus arrhizus)、リンコスボリウム属の一種(Rhynchosporium spp.)、S.アピオスペルムム(S. apiospermum)およびS.プロリフィカンス(S. prolificans)を含むセドスポリウム属の一種(Scedosporium spp.)、スキゾチリウムボミ(Schizothyrium pomi)、

10

スクレロチニア属の一種(Sclerotinia spp.)、スクレロチウム属の一種(Sclerotium spp.)、S.ノドルム(S. nodorum)、S.トリティシ(S. tritici)を含むセプトリア属の一種(Septoria spp.)、スファエロテカマクラリス(Sphaerotheca macularis)、スファエロテカフスカ(Sphaerotheca fusca)(スファエロテカフリギネア(Sphaerotheca fuliginea))、スポロトリクス属の一種(Sporothrix spp.)、スタゴノスボラノドルム(Stagonospora nodorum)、ステムフィリウム属の一種(Stemphylium spp.)、ステレウムヒルスツム(Stereum hirsutum)、タナテホルスクメリス(Thanatephorus cucumeris)、チエラビオプシスバシコラ(Thielaviopsis basicola)、チレチア属の一種(Tilletia spp.)、T.ハルジアヌム(T. harzianum)、T.シュードコニンギイ(T. pseudokoningii)、T.ヴィリデ(T. viride)を含むトリコデルマ属の一種(Trichoderma spp.)、

20

トリコフィトン属の一種(Trichophyton spp.)、チフラ属の一種(Typhula spp.)、ウンシヌラネカトル(Uncinula necator)、ウロシスチス(Urocystis spp.)、ウスチラゴ属の一種(Ustilago spp.)、V.イナエクアリス(V. inaequalis)を含むベンチュリア属の一種(Venturia spp.)、ベルチシリウム属の一種(Verticillium spp.)およびキサントモナス属の一種(Xanthomonas spp.)。

30

【0123】

特に、これらを含む式Iの化合物および殺菌性組成物を用いて、担子菌綱(Basidiomycete)、子囊菌綱(Ascomycete)、卵菌綱(Oomycete)および/または不完全菌類、ブラソクラディオマイセート(Blasocladiomycete)、ツボカビ綱(Chytridiomycete)、グロムス門(Glomeromycete)および/またはケカビ綱(Mucoromycete)における広範囲の菌性植物病原体によって引き起こされる植物病害を防除し得る。

【0124】

40

これらの病原体としては以下が挙げられ得る。

卵菌綱(Oomycete)であって、以下を含む。フィトフトラカプシシ(Phytophthora capsici)、フィトフトラインフェスタンス(Phytophthora infestans)、フィトフトラソヤエ(Phytophthora sojae)、フィトフトラフラガリエ(Phytophthora fragariae)、フィトフトラニコチアナエ(Phytophthora nicotianae)、フィトフトラシンナモミ(Phytophthora cinnamomi)、フィトフトラシトリコラ(Phytophthora citricola)、フィトフトラシトロフトラ(Phytophthora citrophthora)およびフィトフトラエリトロセプチカ(Phytophthora erythroseptica)によつ

50

て引き起こされるものなどのフィトフトラ (*Phytophthora*) 病害; ピシウム
 アファニデルマトム (*Pythium aphanidermatum*)、ピシウムアレ
 ノマネス (*Pythium arrhenomanes*)、ピシウムグラミニコラ (*Py
 thium graminicola*)、ピシウムイレグラレ (*Pythium irr
 egulare*) およびピシウムウルチマム (*Pythium ultimum*) によ
 って引き起こされるものなどのピシウム (*Pythium*) 病害; ペロノスポラデストルク
 トル (*Peronospora destructor*)、ペロノスポラパラシティカ (*Pe
 ronospora parasitica*)、プラズモパラビチコーラ (*Plas
 mopara viticola*)、プラズモパラハルステジイ (*Plasmopara
 halstedii*)、シュードペロノスポラクベンシス (*Pseudoperono
 spora cubensis*)、アルブゴカンジダ (*Albugo candida*)
 、スクレログトラマクロスボラ (*Sclerophthora macrospora*)
 およびブレミアラクツカエ (*Bremia lactucae*) などのツユカビ目 (*Pe
 ronosporales*) によって引き起こされる病害; ならびに、アファノミセスコ
 クリオイデス (*Aphanomyces cochlidioides*)、ラビリンツラゾス
 テラエ (*Labyrinthula zosteriae*)、ペロノスクレロスボラソルギ
 (*Peronosclerospora sorghi*) およびスクレロスボラグラミニ
 コラ (*Sclerospora graminicola*) などの他のもの。

【0125】

子囊菌綱 (*Ascomycetes*) であって、例えば、ステムフィリウムソラニ (*S
 temphylium solani*)、スタゴノスポラタイナネンシス (*Stagon
 ospora tainanensis*)、スピロカエアオレアギネア (*Spiloca
 ea oleaginea*)、セトスファエリアツルシカ (*Setosphaeria
 turcica*)、ピレノカエタリコペリシチ (*Pyrenochaeta lycop
 erisici*)、プレオスポラヘルバルム (*Pleospora herbarum*)
 、フォマデストルクティバ (*Phoma destructiva*)、ファエオスファエ
 リアヘルボトリコイデス (*Phaeosphaeria herpotrichoide
 s*)、ファエオクリプトクスガエウマンニイ (*Phaeocryptocus gaeu
 manni*)、オフィオスファエレラグラミニコラ (*Ophiosphaerella
 graminicola*)、オフィボルスグラミニス (*Ophiobolus gra
 minis*)、レプトスファエリアマクランズ (*Leptosphaeria macu
 lans*)、ヘンデルソニアクレベリマ (*Hendersonia creberrim
 a*)、ヘルミントスポリウムトリティシレペンティス (*Helminthosporiu
 m tritici repentis*)、セトスファエリアツルシカ (*Setospha
 eria turcica*)、ドレックスレラグリシネス (*Drechslera gly
 cines*)、ジディメラブリオニエ (*Didymella bryoniae*)、シ
 クロコニウムオレアギネウム (*Cyloconium oleagineum*)、コリ
 ネスポラカッシイコラ (*Corynespora cassiicola*)、コクリオボ
 ルスサチブス (*Cochliobolus sativus*)、ビポラリスカクティボラ
 (*Bipolaris cactivora*)、リング黒星病菌 (*Venturia i
 naequalis*)、ピレノホラテレス (*Pyrenophora teres*)、コ
 ムギ黄斑病菌 (*Pyrenophora tritici-repentis*)、アルテ
 ルナリアアルテナタ (*Alternaria alternata*)、アルテルナリアブ
 ラッシシコラ (*Alternaria brassicicola*)、アルテルナリアソ
 ラニ (*Alternaria solani*) およびアルテルナリアトマトフィラ (*Al
 ternaria tomatophila*) などのプレオスポラ目 (*Pleospor
 ales*); セプトリアトリティシ (*Septoria tritici*)、セプトリア
 ノドルム (*Septoria nodorum*)、セプトリアグリシネス (*Septor
 ia glycines*)、セルコスボラアラキディコーラ (*Cercospora a
 rachidicola*)、セルコスボラソジナ (*Cercospora soja*)

10

20

30

40

50

)、セルコスボラセアエマイデイス (*Cercospora zeae-maydis*)、セルコスボレラカプセラエ (*Cercospora capsellae*) およびセルコスボレラヘルポトリコイデス (*Cercospora herpotrichoides*) などのカプノディウム目 (*Capnodiales*) ; クラドスポリウムカルボフィルム (*Cladosporium carpophilum*)、クラドスポリウムエフスム (*Cladosporium effusum*)、パッサロラフルバ (*Passalora fulva*)、クラドスポリウムオキシスポルム (*Cladosporium oxysporum*)、ドチストロマセプトスポルム (*Dothistroma septosporum*)、イサリオプシスクラビスポラ (*Isariopsis clavispora*)、マイコスファエレラフィジエンシス (*Mycosphaerella fijiensis*)、コムギ葉枯病菌 (*Mycosphaerella graminicola*)、マイコベロシエラコエブケイイ (*Mycovellosiella koepkei*)、ファエオイサリオプシスバタチコラ (*Phaeoisariopsis bataticola*)、シュードセルコスボラピチス (*Pseudocercospora vitis*)、シュードセルコスボレラヘルポトリコイド (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、ラムラリアベチコラ (*Ramularia beticola*)、ラムラリアコロシグニ (*Ramularia collo-cygni*)、ゲーウマノミセスグラミニス (*Gaeumannomyces graminis*)、マグナポルテグリセア (*Magnaporthe grisea*)、イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) などのマグナポルテ目 (*Magnaporthales*) ; アニソグラマアノマラ (*Anisogramma anomala*)、アピオグノモニアエラブンダ (*Apiognomoniam errabunda*)、サイトスボラプラタニ (*Cytospora platani*)、ジアポルテファセオロルム (*Diaporthe phaseolorum*)、ディスクラデストルクティバ (*Discula destructiva*)、グノモニアフルクティコーラ (*Gnomonia fructicola*)、グリネリアウビコーラ (*Greeneria uvicola*)、メランコニウムジュグランディヌム (*Melanconium juglandinum*)、ホモプシスピティコーラ (*Phomopsis viticola*)、シロコッカスクラビギグネンティ・ジュグランダセアラム (*Sirococcus clavigignenti-juglandacearum*)、ツバキアドリイナ (*Tubakia dryina*)、ディカルペラ属の一種 (*Dicarpella* spp.)、バルサセラトスベルマ (*Valsa ceratosperma*) などのジアポルテ目 (*Diaporthales*) ; ならびに、アクチノチリウムグラミニス (*Actinothyrium graminis*)、アスコキタピシ (*Ascochyta pisi*)、アスペルギルスフラブス (*Aspergillus flavus*)、アスペルギルスフミガーツス (*Aspergillus fumigatus*)、アスペルギルスニズランス (*Aspergillus nidulans*)、アスペリスポリウムカリカエ (*Asperisporium caricae*)、ブルメリエラジャアピイ (*Blumeriella jaapii*)、カンジダ属の一種 (*Candida* spp.)、カプノジウムラモスム (*Capnodium ramosum*)、セファロアスキス属の一種 (*Cephaloascus* spp.)、セファロスポリウムグラミネウム (*Cephalosporium gramineum*)、セラトシステスパラドクサ (*Ceratocystis paradoxa*)、キトミウム属の一種 (*Chaetomium* spp.)、ヒメノシフスシュードアルビツス (*Hymenoscyphus pseudoalbidus*)、コッシディオイデス属の一種 (*Coccidioides* spp.)、シリンドロスポリウムパディ (*Cylindrosporium padi*)、ジプロカルボンマラエ (*Diplocarpon malae*)、ドレパノペジザカンペストリス (*Drepanopeziza campestris*)、エルシノエアンペリナ (*Elsinoe ampelina*)、エピコッカムニグラム (*Epicoccum nigrum*)、エピデルモフィトン属の一種 (*Epider*

mophyton spp.)、ユーチパラタ (*Eutypa lata*)、ゲオトリク
 ムカンジズム (*Geotrichum candidum*)、ギベリナセレアリス (*Gi
 bellina cerealis*)、グロエオセルコスボラソルギ (*Gloeocer
 cospora sorghi*)、グロエオデスポミゲナ (*Gloeodes pomi
 gena*)、グロエオスポリウムペレナンス (*Gloeosporium perenn
 ans*) などの他のものによって引き起こされるものといった汚斑病、斑点病、イモチ病
 または胴枯れ病および/または腐敗病; グロエオチニアテムレンタ (*Gloeotini
 a temulenta*)、グリフォスパエリアコルチコラ (*Griphospaeri
 a corticola*)、カバチエラリニ (*Kabatiella lini*)、レブ
 トグラフィウムミクロスボルム (*Leptographium microsporum* 10
)、レプトスファエルニアクラッサスカ (*Leptosphaerulina c
 rassiasca*)、ロフォデルミウムセディチオスム (*Lophodermium
 seditiosum*)、マルソニナグラミニコラ (*Marssonina grami
 nicola*)、コムギ赤かび病菌 (*Microdochium nivale*)、モニ
 リニアフルクティコーラ (*Monilinia fructicola*)、モノグラフエ
 ラアルベセンス (*Monographella albescens*)、モノスポラスク
 スカノンバルス (*Monosporascus cannonballus*)、ナエマシ
 クルス属の一種 (*Naemacyclus* spp.)、オフィオストマノボウルミ (*O
 phiostomanovo-ulmi*)、パラコジジオイデスブラジリエンシス (*Pa
 racoccidioides brasiliensis*)、ペニシリウムエクソパン 20
 スム (*Penicillium expansum*)、ペスタロチアロドデンドリ (*Pe
 stalotia rhododendri*)、ペトリエリジウム属の一種 (*Petri
 ellidium* spp.)、ペジクラ属の一種 (*Pezicula* spp.)、フ
 ィアロホラグレガタ (*Phialophora gregata*)、フィラコラポミゲナ
 (*Phyllachora pomigena*)、フィマトトリクムオムニボラ (*Phy
 matotrichum omnivora*)、フィサロスボラアブディタ (*Physa
 lospora abdita*)、プレクトスポリウムタバシヌム (*Plectospo
 rium tabacinum*)、ポリシタルムプスツランス (*Polyscytalu
 m pustulans*)、シュードベジザメディカギニス (*Pseudopeziza
 medicaginis*)、ピレノベジザブラッシカエ (*Pyrenopeziza
 brassicae*)、ラムリスボラソルギ (*Ramulispora sorghi*) 30
 、ラブドクリンシュードツガエ (*Rhabdocline pseudotsugae*)
 、リンコスボリウムセカリス (*Rhynchosporium secalis*)、イネ
 葉しょう腐敗病菌 (*Sacrocladium oryzae*)、スケドスポリウム属の
 一種 (*Scedosporium* spp.)、スキゾチリウムボミ (*Schizoth
 yrium pomi*)、スクレロチニアスクレロティオルム (*Sclerotinia
 sclerotiorum*)、スクレロチニアミノル (*Sclerotinia mi
 nor*); スクレロチウム属の一種 (*Sclerotium* spp.)、チフライシカリ
 エンシス (*Typhula ishikariensis*)、セイマトスポリウムマリエ
 (*Seimatosporium mariae*)、レプテウチバクブレッシ (*Lept
 eutypa cupressi*)、セプトシタルボルム (*Septocyta rub
 orum*)、スファセロマベルセー (*Sphaceloma perseae*)、スポロ
 ネマファシディオイデス (*Sporonema phacididioides*)、スティグ
 ミナパルミボラ (*Stigmina palmivora*)、タペシアヤルンデ (*Tap
 esia yallundae*)、タフリナブラタ (*Taphrina bullata*)
 、チエビオプシスバシコラ (*Thielviopsis basicola*)、トリコ
 セプトリアグルクチゲナ (*Trichoseptoria fructigena*)、ジ
 ゴ
 フィアラジャミセンシス (*Zygophiala jamaicensis*); 例えばブル
 ルメリアグラミニス (*Blumeria graminis*)、エリシフェポリゴニ (*E 50*

rysiphe polygoni)、ウンシヌラネカトル(Uncinula necator)、スファエロテカフリゲナ(Sphaerotheca fuligena)、リンゴうどんこ病菌(Podosphaera leucotricha)、ポドスパエラマクラリス(Podosphaera macularis)、ゴロビノマイセスコラセルム(Golovinomyces cichoracearum)、レベイルラタウリカ(Leveillula taurica)、ミクロスファエラディフッサ(Microsphaera diffusa)、オイディオプシスゴッシピイ(Oidiopsis gossypii)、フィラクチニアグッタタ(Phyllactinia guttata)およびオイジウムアラキデイス(Oidium arachidis)などのウドンコカビ目(Erysiphales)によって引き起こされるものといったウドンコ病病害;例えばドチオレアラロマチカ(Dothiorella aromatica)、ジプロディアセリアタ(Diplodia seriata)、ガイグナルディアビドウェリイ(Guignardia bidwellii)、ボトリチスシネレア(Botrytis cinerea)、ボトリオチニアアリイ(Botryotinia allii)、ボトリオチニアファビ(Botryotinia fabae)、フシコクムアミグダリ(Fusicoccum amygdali)、ラシオジプロディアテオブロマエ(Lasiodiplodia theobromae)、マクロフォーマテイコラ(Macrophoma theicola)、マクロフォミナファセオリナ(Macrophomina phaseolina)、フィロスティクタククルビタセアルム(Phyllosticta cucurbitacearum)などのボトリオスフェリア目(Botryosphaeriales)によって引き起こされるものといったかび類;例えばコレトトリカムグロエオスポリオイデス(Colletotrichum gloeosporioides)、コレトトリカムラゲナリウム(Colletotrichum lagenarium)、コレトトリカムゴッシピイ(Colletotrichum gossypii)、グロメララシングラタ(Glomerella cingulata)およびコレトトリカムグラミニコラ(Colletotrichum graminicola)などのグロメララレス属(Glomerellales)によって引き起こされるものといった炭疽病;ならびに、例えばアクレモニウムストリクツム(Acremonium strictum)、クラビセプスブルブレア(Claviceps purpurea)、フザリウムクルモルム(Fusarium culmorum)、フザリウムグラミネアルム(Fusarium graminearum)、フザリウムビルグリホルメ(Fusarium virguliforme)、フザリウムオキシスポルム(Fusarium oxysporum)、フザリウムサブグルチナンス(Fusarium subglutinans)、フザリウムオキシスポルム(Fusarium oxysporum f. sp. cubense)、ゲルラキアニバレ(Gerlachia nivale)、ギベレラフジクロイ(Gibberella fujikuroi)、ギベレラゼアエ(Gibberella zeae)、グリオクラジウム属の一種(Gliocladium spp.)、ミロテシウムベルカリア(Myrothecium verrucaria)、ネクトリアラムラライエ(Nectria ramulariae)、トリコデルマビリデ(Trichoderma viride)、トリコテシウムロセウム(Trichothecium roseum)およびベルチシリウムテオブロマエ(Verticillium theobromae)などの肉座菌目(Hypocreales)によって引き起こされるものといった萎凋病または胴枯れ病。

【0126】

例えばウスチラギノイデアビレンス(Ustilaginoida virens)、ウスチラゴヌダ(Ustilago nuda)、ウスチラゴトリティシ(Ustilago tritici)、ウスチラゴゼアエ(Ustilago zeae)などのクロボキン目(Ustilaginales)によって引き起こされるものといった黒穂病菌を含む担子菌綱(Basidiomycete)、例えばセロテリウムフィチ(Cer

10

20

30

40

50

oteliu m f i c i)、クリソミクサアルクトスタフィリ (Chrysomyxa arctostaphyli)、コレオスפורウムイポモエアエ (Coleosporium ipomoeae)、ヘミレイアバスタトリクス (Hemileia vastatrix)、プッシニアアラキディス (Puccinia arachidis)、プッシニアカカバタ (Puccinia cacabata)、プッシニアグラミニス (Puccinia graminis)、プッシニアレコンディタ (Puccinia recondita)、プッシニアソルギ (Puccinia sorghi)、プッシニアホルデイ (Puccinia hordei)、プッシニアストリイフォルミス (Puccinia striiformis f.sp. Hordei)、プッシニアストリイフォルミス (Puccinia striiformis f.sp. Secalis)、プッシニアストルムコリリ (Pucciniastrum coryli) などのサビキン目 (Pucciniales)、または、クロナルチウムリビコラ (Cronartium ribicola)、ジムノスポランギウムジュニペリ - ビジニアネ (Gymnosporangium juniperi-virginianae)、メランブソラメデュサエ (Melampsora medusae)、ファコブソラパチリジ (Phakopsora pachyrhizi)、フラグミジウムムクロナツム (Phragmidium mucronatum)、フィソペラアンペロシディス (Physopella ampeloidis)、トランスケリアディスコロール (Tranzschelia discolor) およびウロマイセスビシエ - ファビエ (Uromyces viciae-fabae) などのサビキン目 (Uredinales) によって引き起こされるものといったサビ病菌；ならびに、クリプトコックス属の一種 (Cryptococcus spp.)、エクソバシジウムベクスアン (Exobasidium vexans)、マラスミエルスイノデルマ (Marasmiellus inoderma)、マイセナ属の一種 (Mycena spp.)、スファセロテカレイリアナ (Sphaerellotheca reiliana)、チフライシカリエンシス (Typhula ishikariensis)、ウロシスチスアグロピリ (Urocystis agropyri)、イテルソニリアペルプレキサンス (Iterosonilia perplexans)、クルチシウムインビスム (Corticium invisum)、ラエチサリアフシホルミス (Laetisaria fuciformis)、ワイテアシルシナタ (Waitea circinata)、イネ紋枯病菌 (Rhizoctonia solani)、テンサイ根腐病菌 (Thanetophorus cucurmeris)、エンチロマダリアエ (Entyloma dahliae)、エンチロメラミクロスポラ (Entylomella microspora)、ネオボシアモリニアエ (Neovossia molinae) およびチレチアカリエス (Tilletia caries) によって引き起こされるものなどの他の腐敗病および病害。

【0127】

フィソデルママイディス (Physotherma maydis) などのコウマクノウキン目 (Blastocladiomycetes)。

【0128】

コアネフォラククリピタルム (Choanephora cucurbitarum) ; ムコール属の一種 (Mucor spp.) ; リゾプスアルヒズス (Rhizopus arrhizus) などのケカビ綱 (Mucoromycetes)。

ならびに、上記に列挙されているものと近縁の他の種および属によって引き起こされる病害。

【0129】

その殺菌活性に追加して、化合物およびこれらを含む組成物はまた、エルウィニアアミロボラ (Erwinia amylovora)、エルウィニアカラトボラ (Erwinia caratovora)、キサントモナスカムペストリス (Xanthomonas campestris)、シュウドモナスシリंगाエ (Pseudomonas syringae)、ストルプトマイセススカビス (Strptomyces scab

10

20

30

40

50

i e s) などのバクテリアおよび他の関連する種、ならびに、一定の原生動物に対する活性を有し得る。

【 0 1 3 0 】

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

【 0 1 3 1 】

本発明に係る有用な植物および／または標的作物は、例えば、昆虫抵抗性（例えばB t、およびV I P 品種）ならびに病害抵抗性、除草剤耐性（商品名R o u n d u p R e a d y（登録商標）およびL i b e r t y L i n k（登録商標）で市販されている例えばグリホサート - およびグルホシネート - 耐性トウモロコシ品種）および線虫抵抗性品種などの従来の品種、ならびに、遺伝子的に強化または遺伝子操作された品種を含む。一例として、好適に遺伝子的に強化または遺伝子操作された品種は、S t o n e v i l l e 5 5 9 9 B R 綿およびS t o n e v i l l e 4 8 9 2 B R 綿品種を含む。

【 0 1 3 2 】

「有用な植物」および／または「標的作物」という用語は、従来の交配または遺伝子操作方法によって、プロモキシニルのような除草剤、または、ある分類の除草剤（例えば、H P P D 抑制剤、A L S 抑制剤、例えばプリミスルフロン、プロスルフロンおよびトリフロキシスルフロン、E P S P S（5 - エノール - ピロピル - シキメート - 3 - リン酸塩 - シンターゼ）抑制剤、G S（グルタミンシンターゼ）抑制剤またはP P O（プロトボルフィリノーゲン - オキシダーゼ）抑制剤など）に対する耐性がもたらされた有用な植物をも含むと理解されるべきである。従来の交配方法（突然変異誘発）によって、例えばイマザモックスといったイミダゾリノンに対する耐性がもたらされた作物の一例は、C l e a r f i e l d（登録商標）夏ナタネ（カノーラ）である。遺伝子操作方法によって除草剤またはあるクラスの除草剤に対する耐性がもたらされた作物の例としては、商品名R o u n d u p R e a d y（登録商標）、H e r c u l e x I（登録商標）およびL i b e r t y L i n k（登録商標）で市販されているグリホサート - およびグルホシネート - 耐性トウモロコシ品種が挙げられる。

【 0 1 3 3 】

「有用な植物」および／または「標的作物」という用語は、自然発生的なもの、または、有害な昆虫に対する抵抗性が与えられたものを含むと理解されるべきである。これは、トキシン - 産生バクテリア由来として公知であるものなどの1種以上の選択的に作用するトキシンの合成能を例えば有するよう、組換えD N A 技術を用いることで形質転換された

植物を含む。発現されることが可能であるトキシンの例としては、 δ -エンドトキシン、栄養型殺虫性タンパク質 (Vip)、線虫共生バクテリアの殺虫性タンパク質、ならびに、サソリ、蛛形類、大型のハチ (wasp) および菌類によって産生されるトキシンが挙げられる。バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) トキシンを発現するよう変性された作物の一例は、Bt トウモロコシ Knock Out (登録商標) (Syngenta Seeds) である。殺虫性耐性をコードする2種以上の遺伝子を含み、それ故、2種以上のトキシンを発現する作物の一例は、Vip Cot (登録商標) (Syngenta Seeds) である。作物またはその種子材料もまた、複数種の有害生物に対して耐性であることが可能である (いわゆる、遺伝子修飾により形成される場合の重疊的なトランスジェニックイベント)。例えば、植物は、例えば *Herculex I* (登録商標) (Dow AgroSciences, Pioneer Hi-Bred International) のように除草剤耐性であると同時に、殺虫性タンパク質の発現能を有していることが可能である。

10

【0134】

用語「有用な植物」および/または「標的作物」は、例えば、いわゆる「感染特異的タンパク質」(PRP、例えば欧州特許出願公開第0 392 225号明細書を参照のこと)などの選択的な作用を有する抗病原性物質を合成することが可能であるよう組換えDNA技術を用いて形質転換された有用な植物をも含むと理解されるべきである。このような抗病原性物質およびこのような抗病原性物質を合成可能である形質転換植物の例は、例えば、欧州特許出願公開第0 392 225号明細書、国際公開第95/33818号パンフレットおよび欧州特許出願公開第0 353 191号明細書から公知である。このような形質転換植物を製造する方法は一般に当業者に公知であると共に、例えば、上記の公報に記載されている。

20

【0135】

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

30

40

【0136】

さらに、本発明の文脈においては、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、

50

C r y 1 F a 2、C r y 2 A b、C r y 3 A、C r y 3 B b 1もしくはC r y 9 Cといったδ - エンドトキシン、または、例えばV i p 1、V i p 2、V i p 3もしくはV i p 3 Aといった栄養型殺虫性タンパク質 (V i p) とは、特にハイブリッドトキシン、切断型トキシンおよび修飾トキシンでもあることが理解されるべきである。ハイブリッドトキシンは、これらのタンパク質の異なるドメインの新たな組み合わせによって組換えで生成される (例えば、国際公開第02/15701号パンフレットを参照のこと)。例えば切断型C r y 1 A bといった切断型トキシンが公知である。修飾トキシンの場合、天然トキシンの1種以上のアミノ酸が置換される。このようなアミノ酸置換において、好ましくは自然に存在しないタンパク分解酵素認識配列がトキシンに挿入され、例えば、C r y 3 A 055の場合には、カテプシン - G - 認識配列がC r y 3 A トキシンに挿入される (国際公開第03/018810号パンフレットを参照のこと)。

10

【0137】

このようなトキシン、または、このようなトキシンを合成可能な形質転換植物のさらなる例が、例えば、欧州特許出願公開第A - 0 374 753号明細書、国際公開第93/07278号パンフレット、国際公開第95/34656号パンフレット、欧州特許出願公開第A - 0 427 529号明細書、欧州特許出願公開第A - 451 878号明細書および国際公開第03/052073号パンフレットに開示されている。

【0138】

このような形質転換植物の調製プロセスは一般に当業者に公知であり、例えば、上記の刊行物において記載されている。C r y I - タイプデオキシリボ核酸およびその調製は、例えば、国際公開第95/34656号パンフレット、欧州特許出願公開第A - 0 367 474号明細書、欧州特許出願公開第A - 0 401 979号明細書および国際公開第90/13651号パンフレットから公知である。

20

【0139】

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

【0140】

殺虫耐性をコードし、1種以上のトキシンを発現する1種以上の遺伝子を含む形質転換植物は公知であり、そのいくつかは市販されている。このような植物の例は：Y i e l d G a r d (登録商標) (C r y 1 A b トキシンを発現するトウモロコシ品種)；Y i e l d G a r d R o o t w o r m (登録商標) (C r y 3 B b 1 トキシンを発現するトウモロコシ品種)；Y i e l d G a r d P l u s (登録商標) (C r y 1 A b およびC r y 3 B b 1 トキシンを発現するトウモロコシ品種)；S t a r l i n k (登録商標) (C r y 9 C トキシンを発現するトウモロコシ品種)；H e r c u l e x I (登録商標) (C r y 1 F a 2 トキシンおよび酵素ホスフィノトリシンN - アセチルトランスフェラーゼ (P A T) を発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成されているトウモロコシ品種)；N u C O T N 33B (登録商標) (C r y 1 A c トキシンを発現する綿品種)；B o l l g a r d I (登録商標) (C r y 1 A c トキシンを発現する綿品種)；B o l l g a r d I I (登録商標) (C r y 1 A c およびC r y 2 A b トキシンを発現する綿品種)；V i p C o t (登録商標) (V i p 3 A およびC r y 1 A b トキシンを発現する綿品種)；N e w L e a f (登録商標) (C r y 3 A トキシンを発現するジャガイモ品種)；N a t u r e G a r d (登録商標)、A g r i s u r e (登録商標) G T A d v a n t a g e (G A 21グリホサート - 耐性形質)、A g r i s u r e (登録商標) C B A d v a n t a g e (B t 11コーン穿孔性害虫 (C B) 形質) およびP r o t e c t a (登録商標) である。

30

40

【0141】

このような形質転換作物のさらなる例は以下のとおりである。

【0142】

1 . S y n g e n t a S e e d s S A S , C h e m i n d e l ' H o b i t

50

27, F-31 790 St. Sauveur, France 製 Bt11 トウモロコシ、登録番号 C / FR / 96 / 05 / 10。切断型 Cry1Ab トキシンのトランスジェニック発現により、アワノメイガ (ヨーロッパアワノメイガ (*Ostrinia nubilalis*)) およびセサミアノナグリオイデス (*Sesamia nonagrioides*)) に対する耐性が付与された遺伝子操作されたトウモロコシ (*Zea mays*)。Bt11 トウモロコシはまた、酵素 PAT をトランスジェニック発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成している。

【0143】

2. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France 製 Bt176 トウモロコシ、登録番号 C / FR / 96 / 05 / 10。Cry1Ab トキシンのトランスジェニック発現によって、アワノメイガ (ヨーロッパアワノメイガ (*Ostrinia nubilalis*)) およびセサミアノナグリオイデス (*Sesamia nonagrioides*)) に対する耐性が付与された遺伝子操作されたトウモロコシ (*Zea mays*)。Bt176 トウモロコシはまた、酵素 PAT をトランスジェニック発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成している。

10

【0144】

3. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France 製 MIR604 トウモロコシ、登録番号 C / FR / 96 / 05 / 10。修飾 Cry3A トキシンのトランスジェニック発現により昆虫耐性が付与されたトウモロコシ。このトキシンは、カテプシン-G-タンパク分解酵素認識配列の挿入により修飾された Cry3A055 である。このような形質転換トウモロコシ植物の調製は、国際公開第 03 / 018810 号パンフレットに記載されている。

20

【0145】

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

【0146】

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

30

【0147】

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

【0148】

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

40

50

ガを含む一定の鱗翅目に対する耐性がもたらされる。

【0149】

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

【0150】

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

【0151】

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

【0152】

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

【0153】

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

【0154】

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

【0155】

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

【0156】

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

【0157】

乳化性濃縮物は水または他の液体中に分散性である均質な液体組成物であって、活性な

10

20

30

40

50

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

【0158】

粒状配合物は押出物および比較的粗大な粒子の両方を含み、通常は、処理が必要とされる領域に希釈されることなく適用される。粒状配合物に係る典型的なキャリアとしては、活性な化合物を吸収するか活性な化合物でコーティング可能である、砂、フーラー土、アタパルジャイトクレイ、ベントナイトクレイ、モンモリロナイトクレイ、パーミキュライト、パーライト、炭酸カルシウム、れんが、軽石、葉ろう石、カオリン、ドロマイト、焼き石膏、木粉、粉碎したトウモロコシ穂軸、粉碎したピーナッツの外殻、砂糖、塩化ナトリウム、硫酸ナトリウム、ナトリウムケイ酸、ホウ酸ナトリウム、マグネシア、雲母、酸化鉄、酸化亜鉛、酸化チタン、酸化アンチモン、氷晶石、石膏、珪藻土、硫酸カルシウムおよび他の有機もしくは無機材料が挙げられる。粒状配合物は通常 5% ~ 25% の活性成分を含有し、これは、高沸点芳香族ナフサ、ケロシンおよび他の石油留分などの表面活性剤、もしくは、植物油；ならびに / または、デキストリン、膠もしくは合成樹脂などの展着剤を含んでいてもよい。

【0159】

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

【0160】

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

【0161】

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

【0162】

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

【0163】

利用可能である液体キャリアとしては、例えば、水、トルエン、キシレン、石油ナフサ油、作物油、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン、無水酢酸、アセトニトリル、アセトフェノン、酢酸アミル、2 - ブタノン、クロロベンゼン、シクロヘキサノール、アルキル酢酸塩、ジアセトンアルコール、1, 2 - ジクロロプロパン、ジエタノールアミン、p - ジエチルベンゼン、ジエチレングリコール、ジエチレングリコールアビエテート、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエ

チルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N, N - ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1, 4 - ジオキサン、ジブロピレングリコール、ジブロピレングリコールメチルエーテル、ジブロピレングリコールジベンゾエート、ジブロキシトール、アルキルピロリジノン、酢酸エチル、2 - エチルヘキサノール、エチレンカーボネート、1, 1, 1 - トリクロロエタン、2 - ヘプタノン、 α ピネン、d - リモネン、エチレングリコール、エチレングリコールブチルエーテル、エチレングリコールメチルエーテル、 γ - ブチロラクトン、グリセロール、グリセロール二酢酸、グリセロール酢酸、グリセロールトリアセテート、ヘキサデカン、ヘキシレングリコール、酢酸イソアミル、酢酸イソボルニル、イソオクタン、イソホロン、イソプロピルベンゼン、ミリスチン酸イソプロピル、乳酸、ラウリルアミン、メシチルオキシド、メトキシ - プロパノール、メチルイソアミルケトン、メチルイソブチルケトン、ラウリン酸メチル、オクタン酸メチル、オレイン酸メチル、塩化メチレン、m - キシレン、n - ヘキサン、n - オクチルアミン、クタデカン酸、オクチルアミンアセテート、オレイン酸、オレイルアミン、o - キシレン、フェノール、ポリエチレングリコール (P E G 4 0 0)、プロピオン酸、プロピレングリコール、プロピレングリコールモノメチルエーテル、p - キシレン、トルエン、リン酸トリエチル、トリエチレングリコール、キシレンスルホン酸、パラフィン、鉱油、トリクロロエチレン、パークロロエチレン、酢酸エチル、酢酸アミル、酢酸ブチル、メタノール、エタノール、イソプロパノール、および、アミルアルコール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ヘキサノール、オクタノール等などの高分子量アルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、グリセリンおよびN - メチル - 2 - ピロリジノンが挙げられる。濃縮物の希釈には、水が一般的に選択されるキャリアである。

10

20

【 0 1 6 4 】

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

【 0 1 6 5 】

幅広い範囲の表面活性剤が、特に適用前にキャリアで希釈されるよう設計されたものといった、前記液体および固体組成物の両方において有利に利用される。これらの表面活性剤は通常、使用される際、0.1% ~ 15重量%の配合物を含む。これらはアニオン性、カチオン性、ノニオン性または高分子特性であることが可能であり、乳化剤、湿潤剤、懸濁剤として、または、他の目的のために利用されることが可能である。典型的な表面活性剤としては、ラウリル硫酸ジエタノールアンモニウムなどのアルキル硫酸塩；ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなどのアルキルアリアルスルホネート塩；ノニルフェノール - C . s u b . 1 8 エトキシレートなどのアルキルフェノール - アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコール - C . s u b . 1 6 エトキシレートなどのアルコール - アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウムなどの石鹸；ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウムなどのアルキルナフタレンスルホン酸塩；ジ (2 - エチルヘキシル) スルホコハク酸ナトリウムなどのスルホコハク酸塩のジアルキルエステル；ソルビトールオレエートなどのソルビトールエステル；ラウリルトリメチル塩化アンモニウムなどの第4級アミン；ステアリン酸ポリエチレングリコールなどの脂肪酸のポリエチレングリコールエステル；エチレンオキシドおよびプロピレンオキシドのブロックコポリマー；ならびに、モノおよびジアルキルリン酸エステルの塩が挙げられる。

30

40

【 0 1 6 6 】

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

【 0 1 6 7 】

さらに加えて、他の殺生性活性成分または組成物を、本発明の組成物と組み合わせ、本

50

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

【0168】

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

10

【0169】

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

20

【0170】

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

【0171】

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

30

【0172】

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

【0173】

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

40

50

ゾロピリミジン殺菌剤、尿素殺菌剤、バリンアミド殺菌剤および亜鉛殺菌剤が挙げられる。

【 0 1 7 4 】

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

10

20

30

40

50

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

10

20

30

40

50

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

10

20

30

40

50

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

【 0 1 7 5 】

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

【 0 1 7 6 】

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

【 0 1 7 7 】

本発明の化合物は、国際公開第 9 6 1 5 1 2 1 号パンフレットに記載されている一般的なクラスのジオキソモルホリン抗寄生虫性薬剤の誘導体および類似体との組み合わせで、また、国際公開第 9 6 1 1 9 4 5 号パンフレット、国際公開第 9 3 1 9 0 5 3 号パンフレット、国際公開第 9 3 2 5 5 4 3 号パンフレット、欧州特許第 6 2 6 3 7 5 号明細書、欧州特許第 3 8 2 1 7 3 号明細書、国際公開第 9 4 1 9 3 3 4 号パンフレット、欧州特許第 3 8 2 1 7 3 号明細書、および、欧州特許第 5 0 3 5 3 8 号明細書に記載のものなどの駆虫活性環式デブシペプチドとの組み合わせで用いられ得る。

【 0 1 7 8 】

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

10

【 0 1 7 9 】

本発明の化合物は、例えば国際公開第 9 5 / 1 9 3 6 3 号パンフレットまたは国際公開第 0 4 / 7 2 0 8 6 号パンフレットに記載のものといったテルペンアルカロイドであって、特にこれらに開示の化合物との組み合わせで用いられ得る。

【 0 1 8 0 】

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

20

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

30

【 0 1 8 1 】

カルバメート：アラニカルブ、アルジカルブ、2 - s e c - ブチルフェニルメチルカルバメート、ベンフラカルブ、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、クロエトカルブ、エチオフエンカルブ、フェノキシカルブ、フェンチオカルブ、フラチオカルブ、H C N - 8 0 1、イソプロカルブ、インドキサカルブ、メチオカルブ、メソミル、5 - メチル - m - クメニルブチリル (メチル) カルバメート、オキサミル、ピリミカーブ、プロボキスル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、U C - 5 1 7 1 7。

40

【 0 1 8 2 】

ピレスロイド：アクリナチン (a c r i n a t h i n)、アレトリン、アルファメトリン (a l p h a m e t r i n)、5 - ベンジル - 3 - フリルメチル (E) - (1 R) - シス - 2, 2 - ジメチル - 3 - (2 - オキソチオラン - 3 - イリデンメチル) シクロプロパンカルボキシレート、ピフェントリン、β - シフルトリン、シフルトリン、α - シベルメトリン、β - シベルメトリン、ピオアレトリン、ピオアレトリン ((S) - シクロペンチル異性体)、ピオレスメトリン、ピフェントリン、N C I - 8 5 1 9 3、シクロプロトリン、シハロトリン、シチトリン、シフェノトリン、デルタメトリン、エムペントリン、エ

50

スフェンバレレート、エトフェンプロクス、フェンフルトリン、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、フルバリネート（D異性体）、イミプロトリン、シハロトリン、 λ -シハロトリン、ペルメトリン、フェノトリン、プラレトリン、ピレトリン（天然生成物）、レスメスリン、テトラメトリン、トランスフルトリン、 θ -シペルメトリン、シラフルオフエン、 t -フルバリネート、テフルトリン、トラロメトリン、 ζ -シペルメトリン。

【0183】

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

【0184】

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

【0185】

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

【0186】

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

【0187】

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

【0188】

式Iの化合物と活性成分との以下の混合物が好ましい（「TX」という略記は、「本発明のA1～A18（上記）に記載の化合物からなる群から選択される1種の化合物」を意

10

20

30

40

50

味する)。

石油(代替名)(628)+TXから構成される物質群から選択される補助剤、

1, 1 - ビス(4 - クロロフェニル) - 2 - エトキシエタノール(IUPAC名)(910)+TX、2, 4 - ジクロロフェニルベンゼンスルホネート(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1059)+TX、2 - フルオロ - N - メチル - N - 1 - ナフチルアセタミド(IUPAC名)(1295)+TX、4 - クロロフェニルフェニルスルホン(IUPAC名)(981)+TX、アバメクチン(1)+TX、アセキノシル(3)+TX、アセトプロール[CCN]+TX、アクリナトリン(9)+TX、アルジカルブ(16)+TX、アルドキシカルブ(863)+TX、 α - シペルメトリン(202)+TX、アミジチオン(870)+TX、アミドフルメト[CCN]+TX、アミドチオエート(872)+TX、アミトン(875)+TX、シュウ酸水素アミトン(875)+TX、アミトラズ(24)+TX、アラマイト(881)+TX、三酸化ヒ素(882)+TX、AVI382(化合物コード)+TX、AZ60541(化合物コード)+TX、アジンホスエチル(44)+TX、アジンホスメチル(45)+TX、アゾベンゼン(IUPAC名)(888)+TX、アゾシクロチン(46)+TX、アゾトエート(889)+TX、ベノミル(62)+TX、ベノキサホス(代替名)[CCN]+TX、ベンゾキメート(71)+TX、ベンジル安息香酸塩(IUPAC名)[CCN]+TX、ピフェナゼート(74)+TX、ピフェントリン(76)+TX、ピナパクリル(907)+TX、プロフェンバレレート(代替名)+TX、プロモシクレン(918)+TX、プロモホス(920)+TX、プロモホスエチル(921)+TX、プロモプロピレート(94)+TX、ブプロフェジン(99)+TX、ブトカルボキシム(103)+TX、ブトキシカルボキシム(104)+TX、ブチルピリダベン(代替名)+TX、多硫酸カルシウム(IUPAC名)(111)+TX、カンフェクロール(941)+TX、カルバノレート(943)+TX、カルバリル(115)+TX、カルボフラン(118)+TX、カルボフェノチオン(947)+TX、CGA50'439(開発コード)(125)+TX、チノメチオナート(126)+TX、クロルベンシド(959)+TX、クロルジメホルム(964)+TX、クロルジメホルムヒドロクロリド(964)+TX、クロルフェナピル(130)+TX、クロルフェネトール(968)+TX、クロルフェンソン(970)+TX、クロルフェンスルフィド(971)+TX、クロルフェンピンホス(131)+TX、クロロベンジラート(975)+TX、クロロメブホルム(977)+TX、クロロメチウロン(978)+TX、クロロプロピレート(983)+TX、クロルピリホス(145)+TX、クロルピリホスメチル(146)+TX、クロルチオホス(994)+TX、シネリンI(696)+TX、シネリンII(696)+TX、シネリンス(696)+TX、クロフェンテジン(158)+TX、クロサンテル(代替名)[CCN]+TX、クマホス(174)+TX、クロタミトン(代替名)[CCN]+TX、クロトキシホス(1010)+TX、クフラエブ(1013)+TX、シアントエート(1020)+TX、シフルメトフェン(CAS登録番号:400882-07-7)+TX、シハロトリン(196)+TX、シヘキサチン(199)+TX、シペルメトリン(201)+TX、DCPM(1032)+TX、DDT(219)+TX、デメフィオン(1037)+TX、デメフィオン - O(1037)+TX、デメフィオン - S(1037)+TX、デメトン(1038)+TX、デメトンメチル(224)+TX、デメトン - O(1038)+TX、デメトン - O - メチル(224)+TX、デメトン - S(1038)+TX、デメトン - S - メチル(224)+TX、デメトン - S - メチルスルホン(1039)+TX、ジアフェンチウロン(226)+TX、ジアリホス(1042)+TX、ダイアジノン(227)+TX、ジクロフルアニド(230)+TX、ジクロルボス(236)+TX、ジクリホス(代替名)+TX、ジコホル(242)+TX、ジクロトホス(243)+TX、ジエノクロル(1071)+TX、ジメホクス(1081)+TX、ジメトエート(262)+TX、ジナクチン(代替名)(653)+TX、ジネクス(1089)+TX、ジネクスジクレキシシ(1089)+TX、ジノブトン(269)+TX、ジノカップ(270)+TX、ジノカップ - 4[CCN]

10

20

30

40

50

+TX、ジノカップ-6 [CCN]+TX、ジノクトン(1090)+TX、ジノペント
 ン(1092)+TX、ジノスルホン(1097)+TX、ジノテルボン(1098)+
 TX、ジオキサチオン(1102)+TX、ジフェニルスルホン(IUPAC名)(11
 03)+TX、ジスルフィラム(代替名)[CCN]+TX、ジスルホトン(278)+
 TX、DNOC(282)+TX、ドフェナピン(1113)+TX、ドラメクチン(代
 替名)[CCN]+TX、エンドスルファン(294)+TX、エンドチオン(1121
)+TX、EPN(297)+TX、エピリノメクチン(代替名)[CCN]+TX、エ
 チオン(309)+TX、エトエートメチル(1134)+TX、エトキサゾール(32
 0)+TX、エトリムホス(1142)+TX、フェナザフロル(1147)+TX、フェ
 ナザキン(328)+TX、酸化フェンブタズ(330)+TX、フェノチオカルブ
 (337)+TX、フェンプロパトリン(342)+TX、フェンピラド(代替名)+TX
 X、フェンピロキシメート(345)+TX、フェンソン(1157)+TX、フェント
 リファニル(1161)+TX、フェンバレレート(349)+TX、フィプロニル(3
 54)+TX、フルアクリピリム(360)+TX、フルアズロン(1166)+TX、
 フルベンジミン(1167)+TX、フルシクロクスロン(366)+TX、フルシトリ
 ネット(367)+TX、フルエネチル(1169)+TX、フルフェノクスロン(37
 0)+TX、フルメトリン(372)+TX、フルオルベンシド(1174)+TX、フ
 ルバリネート(1184)+TX、FMC1137(開発コード)(1185)+TX、
 ホルメタネート(405)+TX、ホルメタネートヒドロクロリド(405)+TX、ホ
 ルモチオン(1192)+TX、ホルムパラネート(1193)+TX、 γ -HCH(4
 30)+TX、グリオジン(1205)+TX、ハルフェンプロクス(424)+TX、
 ヘプテノホス(432)+TX、ヘキサデシルシクロプロパンカルボキシレート(IUP
 AC/Chemical Abstracts名)(1216)+TX、ヘキシチアゾク
 ス(441)+TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542)+TX、イソカルボホス
 (代替名)(473)+TX、イソプロピルO-(メトキシアミノチオホスホリル)サリ
 チレート(IUPAC名)(473)+TX、イベルメクチン(代替名)[CCN]+TX
 X、ジャスモリンI(696)+TX、ジャスモリンII(696)+TX、ジョドフェ
 ンホス(1248)+TX、リンダン(430)+TX、ルフエヌロン(490)+TX
 、マラチオン(492)+TX、マロノベン(1254)+TX、メカルバム(502)
 +TX、メホスフォラン(1261)+TX、メスルフェン(代替名)[CCN]+TX
 X、メタクリホス(1266)+TX、メタミドホス(527)+TX、メチダチオン(5
 29)+TX、メチオカルブ(530)+TX、メソミル(531)+TX、臭化メチル
 (537)+TX、メトルカルブ(550)+TX、メピンホス(556)+TX、メキ
 サカルベート(1290)+TX、ミルベメクチン(557)+TX、ミルベマイシンオ
 キシム(代替名)[CCN]+TX、ミパホクス(1293)+TX、モノクロトホス(5
 61)+TX、モルホチオン(1300)+TX、モキシデクチン(代替名)[CCN]
]+TX、ナレド(567)+TX、NC-184(化合物コード)+TX、NC-51
 2(化合物コード)+TX、ニフルリジド(1309)+TX、ニッコマイシン(代替名
) [CCN]+TX、ニトリラカルブ(1313)+TX、ニトリラカルブ1:1塩化亜
 鉛錯体(1313)+TX、NNI-0101(化合物コード)+TX、NNI-025
 0(化合物コード)+TX、オメトエート(594)+TX、オキサミル(602)+TX
 X、オキシデプロホス(1324)+TX、オキシジスルホトン(1325)+TX、p
 p'-DDT(219)+TX、パラチオン(615)+TX、ペルメトリン(626)
 +TX、石油(代替名)(628)+TX、フェンカプトン(1330)+TX、フェン
 トエート(631)+TX、ホレート(636)+TX、ホサロン(637)+TX、ホ
 スホラン(1338)+TX、ホスメット(638)+TX、ホスファミドン(639)
 +TX、ホキシム(642)+TX、ピリミホスメチル(652)+TX、ポリクロロテ
 ルペン(慣習名)(1347)+TX、ポリナクチン(代替名)(653)+TX、プロ
 クロノール(1350)+TX、プロフェノホス(662)+TX、プロマシル(135
 4)+TX、プロパルギット(671)+TX、プロペタムホス(673)+TX、プロ

10

20

30

40

50

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

10

20

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

30

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

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

40

1-ヒドロキシ-1H-ピリジン-2-チオン(IUPAC名)(1222)+TX、4-(キノキサリン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド(IUPAC名)(748)+TX、8-硫酸ヒドロキシキノリン(446)+TX、プロノボール(97)+TX、ニオクタノン酸銅(IUPAC名)(170)+TX、水酸化銅(IUPAC名)(169)+TX、クレゾール[CCN]+TX、ジクロロフェン(232)+TX、ジピリチオン(1105)+TX、ドジチン(1112)+TX、フェナミノスルフ(1144)+TX、ホルムアルデヒド(404)+TX、ヒドラルガフェン(代替名)[CCN]+TX、カスガマイシン(483)+TX、カスガマイシンヒドロクロリド水和物(483)+TX、ニッケルビス(ジメチルジチオカルバメート)(IUPAC名)(1308)+TX、ニトラピリン(580)+TX、オクチリノン(590)+TX、オキシリン

50

酸(606)+TX、オキシテトラサイクリン(611)+TX、硫酸ヒドロキシキノリンカリウム(446)+TX、プロベナゾール(658)+TX、ストレプトマイシン(744)+TX、ストレプトマイシンセスキスルフェート(744)+TX、テクロフタラム(766)+TX、およびチオメルサル(代替名)[CCN]+TXから構成される物質群から選択される殺バクテリア剤、

リンゴコカクモンハマキ(*Adoxophyes orana*)GV(代替名)(12)+TX、アグロバクテリウムラジオバクター(*Agrobacterium radiobacter*)(代替名)(13)+TX、

アムブリセイウス属の一種(*Amblyseius spp.*)(代替名)(19)+TX、アナグラファファルシフェラ(*Anagrapta falcifera*)NPV(代替名)(28)+TX、

アングル

スアトムス(*Anagrus atomus*)(代替名)(29)+TX、アブラコバチ

(*Aphelinus abdominalis*)(代替名)(33)+TX、コレマン

アブラバチ(*Aphidius colemani*)(代替名)(34)+TX、ショク

ガタマバエ(*Aphidoletes aphidimyza*)(代替名)(35)+TX、

オートグラファカリホルニカ(*Autographa californica* NPV)(代替名)(38)+TX、

バシラスフィルムス(*Bacillus firmus*)(代替名)(48)+TX、

バシラススファエリクス(*Bacillus sphaericus* Neide)(学名)(49)+TX、

バチルスチューリングゲンシス(*Bacillus thuringiensis* Berliner)(学名)(51)+TX、

バチルスチューリングゲンシス(*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*)(学名)(51)+TX、

バチルスチューリングゲンシス(*Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*)(学名)(51)+TX、

バチルスチューリングゲンシス(*Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis*)(学名)(51)+TX、

バチルスチューリングゲンシス(*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*)(学名)(51)+TX、

バチルスチューリングゲンシス(*Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*)(学名)(51)+TX、

ベアウベリアバッシアナ(*Beauveria bassiana*)(代替名)(53)+TX、

ベアウベリアブロングニアルチイ(*Beauveria brongniartii*)(代替名)(54)+TX、

ヤマトクサカゲロウ(*Chrysoperla carnea*)(代替名)(151)+TX、

ツマアカオオヒメテントウ(*Cryptolaemus montrouzieri*)(代替名)(178)+TX、

コドリガ(*Cydia pomonella*)GV(代替名)(191)+TX、

ハモグリコマコバチ(*Dacnusa sibirica*)(代替名)(212)+TX、

イサエアヒメコバチ(*Diglyphus isaea*)(代替名)(254)+TX、

オンシツツヤコバチ(*Encarsia formosa*)(学名)(293)+TX、

サバクツヤコバチ(*Eretmocerus eremicus*)(代替名)(300)+TX、

アメリカタバコガ(*Helicoverpa zea*)NPV(代替名)(431)+TX、

ヘテロルハブジチスバクテリオホラ(*Heterorhabditis bacteriophora*)およびH.メギジス(*H. megidis*)(代替名)(433)+TX、

ヒポダミアコンベルゲンス(*Hippodamia convergens*)(代替名)(442)+TX、

フジコナヒゲナガトビコバチ(*Leptomastix dactylopii*)(代替名)(488)+TX、

マクロロフスカリジノサス(*Macrolophus caliginosus*)(代替名)(491)+TX、

ヨトウガ(*Mamestra brassicae*)NPV(代替名)(494)+TX、

メタフィクスヘルボルス(*Metaphycus helvolus*)(代替名)(522)+TX、

メタリジウムアニソプリアエ(*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*)(学名)(523)+TX、

メタリジウムアニソプリアエ(*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*)(学名)(523)+TX、

マツノキハバチ(*Neodiprion sertifer*

10

20

30

40

50

NPV)およびN.レコンテイ(N. lecontei NPV)(代替名)(575)+TX、ヒメハナカメムシ属の一種(Orius spp.)(代替名)(596)+TX、パエシロマイセスフモソロセウス(Paecilomyces fumosoroseus)(代替名)(613)+TX、チリカブリダニ(Phytoseiulus persimilis)(代替名)(644)+TX、シロイチモジヨトウ(Spodoptera exigua)マルチカプシド核多角体ウイルス(学名)(741)+TX、ステイネルネマビビオニス(Steinernema bibionis)(代替名)(742)+TX、ステイネルネマカルボカプサエ(Steinernema carpocapsae)(代替名)(742)+TX、ステイネルネマフェルチアエ(Steinernema feltiae)(代替名)(742)+TX、ステイネルネマグラセリ(Steinernema glaseri)(代替名)(742)+TX、ステイネルネマリオブラエb(Steinernema riobrave)(代替名)(742)+TX、ステイネルネマリオブラビス(Steinernema riobravis)(代替名)(742)+TX、ステイネルネマスカプテリスキ(Steinernema scapterisci)(代替名)(742)+TX、ステイネルネマ属の一種(Steinernema spp.)(代替名)(742)+TX、トリコグラマ属の一種(Trichogramma spp.)(代替名)(826)+TX、チフロドロムスオクシデンタリス(Typhlodromus occidentalis)(代替名)(844)およびベルチシリウムレカニイ(Verticillium lecanii)(代替名)(848)+TXから構成される物質群から選択される生物剤、

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

10

20

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

30

(E)-デカ-5-エン-1-イルアセテートを伴う(E)-デカ-5-エン-1-オール(IUPAC名)(222)+TX、(E)-トリデカ-4-エン-1-イルアセテート(IUPAC名)(829)+TX、(E)-6-メチルヘプタ-2-エン-4-オール(IUPAC名)(541)+TX、(E,Z)-テトラデカ-4,10-ジエン-1-イルアセテート(IUPAC名)(779)+TX、(Z)-ドデカ-7-エン-1-イルアセテート(IUPAC名)(285)+TX、(Z)-ヘキサデカ-11-エナル(IUPAC名)(436)+TX、(Z)-ヘキサデカ-11-エン-1-イルアセテート(IUPAC名)(437)+TX、(Z)-ヘキサデカ-13-エン-11-イン-1-イルアセテート(IUPAC名)(438)+TX、(Z)-イコス-13-エン-10-オン(IUPAC名)(448)+TX、(Z)-テトラデカ-7-エン-1-アル(IUPAC名)(782)+TX、(Z)-テトラデカ-9-エン-1-オール(IUPAC名)(783)+TX、(Z)-テトラデカ-9-エン-1-イルアセテート(IUPAC名)(784)+TX、(7E,9Z)-ドデカ-7,9-ジエン-1-イルアセテート(IUPAC名)(283)+TX、(9Z,11E)-テトラデカ-9,11-ジエン-1-イルアセテート(IUPAC名)(780)+TX、(9Z,12E)-テトラデカ-9,12-ジエン-1-イルアセテート(IUPAC名)(781)+TX、14-メチルオクタデカ-1-エン(IUPAC名)(545)+TX、4-メチルノナン-5-オールを伴う4-メチルノナン-5-オン(IUPAC名)(544)+TX、 α -ムルチストリアチン(代替名)[CCN]+TX、プレビコミン(代替名)[CCN]+TX、コドレルレ(代替名)[CCN]+TX、コドレモン(代替名)(16

40

50

7) + TX、クエルレ (代替名) (179) + TX、ジスパールア (277) + TX、ドデカ - 8 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (286) + TX、ドデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (287) + TX、ドデカ - 8 + TX、10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (284) + TX、ドミニカルア (代替名) [CCN] + TX、エチル 4 - メチルオクタノエート (IUPAC 名) (317) + TX、オイゲノール (代替名) [CCN] + TX、フロンタリン (代替名) [CCN] + TX、ゴシップルア (代替名) (420) + TX、グランドルア (421) + TX、グランドルア I (代替名) (421) + TX、グランドルア II (代替名) (421) + TX、グランドルア III (代替名) (421) + TX、グランドルア IV (代替名) (421) + TX、ヘキサルア [CCN] + TX、イブスジエノール (代替名) [CCN] + TX、イブセノール (代替名) [CCN] + TX、ジャポニルア (代替名) (481) + TX、リネアチン (代替名) [CCN] + TX、リトルア (代替名) [CCN] + TX、ルーブルア (代替名) [CCN] + TX、メドルア [CCN] + TX、メガトモ酸 (代替名) [CCN] + TX、メチルオイゲノール (代替名) (540) + TX、ムスカルア (563) + TX、オクタデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (588) + TX、オクタデカ - 3, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (589) + TX、オルフラルア (代替名) [CCN] + TX、オリクタールア (代替名) (317) + TX、オストラモン (代替名) [CCN] + TX、シグルア [CCN] + TX、ソルジジン (代替名) (736) + TX、スルカトール (代替名) [CCN] + TX、テトラデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (785) + TX、トリメドルア (839) + TX、トリメドルア A (代替名) (839) + TX、トリメドルア B₁ (代替名) (839) + TX、トリメドルア B₂ (代替名) (839) + TX、トリメドルア C (代替名) (839) およびトランクコール (代替名) [CCN] + TX から構成される物質群から選択される昆虫フェロモン、

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

1 - ジクロロ - 1 - ニトロエタン (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (1058) + TX、1, 1 - ジクロロ - 2, 2 - ビス (4 - エチルフェニル) - エタン (IUPAC 名) (1056) + TX、1, 2 - ジクロロプロパン (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (1062) + TX、1, 2 - ジクロロプロパンを伴う 1, 3 - ジクロロプロペン (IUPAC 名) (1063) + TX、1 - プロモ - 2 - クロロエタン (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (916) + TX、2, 2, 2 - トリクロロ - 1 - (3, 4 - ジクロロフェニル) 酢酸エチル (IUPAC 名) (1451) + TX、2, 2 - ジクロロビニル 2 - エチルスルフィニルエチルメチルリン酸 (IUPAC 名) (1066) + TX、2 - (1, 3 - ジチオラン - 2 - イル) フェニルジメチルカルバメート (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (1109) + TX、2 - (2 - ブトキシエトキシ) エチルチオシアネート (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (935) + TX、2 - (4, 5 - ジメチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル) フェニルメチルカルバメート (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (1084) + TX、2 - (4 - クロロ - 3, 5 - キシリルオキシ) エタノール (IUPAC 名) (986) + TX、2 - クロロビニルジエチルリン酸 (IUPAC 名) (984) + TX、2 - イミダゾリドン (IUPAC 名) (1225) + TX、2 - イソバレリルインダン - 1, 3 - ジオン (IUPAC

10

20

30

40

50

名) (1246) + TX、2 - メチル (プロブ - 2 - イニル) アミノフェニルメチルカル
 バメート (IUPAC 名) (1284) + TX、2 - チオシアナトエチルラウレート (I
 UPAC 名) (1433) + TX、3 - ブロモ - 1 - クロロプロブ - 1 - エン (IUPA
 C 名) (917) + TX、3 - メチル - 1 - フェニルピラゾール - 5 - イルジメチルカル
 バメート (IUPAC 名) (1283) + TX、4 - メチル (プロブ - 2 - イニル) アミ
 ノ - 3, 5 - キシリルメチルカルバメート (IUPAC 名) (1285) + TX、5, 5
 - ジメチル - 3 - オキソシクロヘキサ - 1 - エニルジメチルカルバメート (IUPAC 名)
 (1085) + TX、アバメクチン (1) + TX、アセフェート (2) + TX、アセタ
 ミプリド (4) + TX、アセチオン (代替名) [CCN] + TX、アセトプロール [CC
 N] + TX、アクリナトリン (9) + TX、アクリロニトリル (IUPAC 名) (861
) + TX、アラニカルブ (15) + TX、アルジカルブ (16) + TX、アルドキシカル
 ブ (863) + TX、アルドリン (864) + TX、アレトリン (17) + TX、アロサ
 ミジン (代替名) [CCN] + TX、アリキシカルブ (866) + TX、 α - シベルメト
 リン (202) + TX、 α - エクジソン (代替名) [CCN] + TX、リン化アルミニウ
 ム (640) + TX、アミジチオン (870) + TX、アミドチオエート (872) + T
 X、アミノカルブ (873) + TX、アミトン (875) + TX、シュウ酸水素アミトン
 (875) + TX、アミトラズ (24) + TX、アナバシン (877) + TX、アチダチ
 オン (883) + TX、AVI382 (化合物コード) + TX、AZ60541 (化合物
 コード) + TX、アザジラクチン (代替名) (41) + TX、アザメチホス (42) + T
 X、アジンホスエチル (44) + TX、アジンホスメチル (45) + TX、アゾトエート
 (889) + TX、パチルスチューリングシス (*Bacillus thuringi
 ensis*) δ エンドトキシン (代替名) (52) + TX、バリウムヘキサフルオロシリ
 ケート (代替名) [CCN] + TX、バリウムポリスルフィド (IUPAC / Chemi
 cal Abstracts 名) (892) + TX、バルトリン [CCN] + TX、バイ
 エル22 / 190 (開発コード) (893) + TX、バイエル22408 (開発コード)
 (894) + TX、ベンジオカルブ (58) + TX、ベンフラカルブ (60) + TX、ベ
 ンサルタップ (66) + TX、 β - シフルトリン (194) + TX、 β - シベルメトリン
 (203) + TX、ピフェントリン (76) + TX、ピオアレトリン (78) + TX、ピ
 オアレトリン S - シクロペンテニル異性体 (代替名) (79) + TX、バイオエタノメト
 リン [CCN] + TX、ピオパーメトリン (908) + TX、ピオレスメトリン (80)
 + TX、ビス (2 - クロロエチル) エーテル (IUPAC 名) (909) + TX、ピスト
 リフルロン (83) + TX、ホウ酸ナトリウム (86) + TX、プロフェンバレレート (代
 替名) + TX、プロムフェンビンホス (914) + TX、プロモシクレン (918) +
 TX、プロモ - DDT (代替名) [CCN] + TX、プロモホス (920) + TX、プロ
 モホスエチル (921) + TX、プフェンカルブ (924) + TX、ププロフェジン (9
 9) + TX、ブタカルブ (926) + TX、ブタチオホス (927) + TX、ブトカルボ
 キシム (103) + TX、ブトネート (932) + TX、ブトキシカルボキシム (104
) + TX、ブチルピリダベン (代替名) + TX、カズサホス (109) + TX、ヒ酸カル
 シウム [CCN] + TX、シアン化カルシウム (444) + TX、多硫酸カルシウム (I
 UPAC 名) (111) + TX、カンフェクロール (941) + TX、カルバノレート (40
 943) + TX、カルバリル (115) + TX、カルボフラン (118) + TX、二硫化
 炭素 (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (945) + TX、四塩
 化炭素 (IUPAC 名) (946) + TX、カルボフェノチオン (947) + TX、カル
 ボスルファン (119) + TX、カルタップ (123) + TX、カルタップヒドロクロリ
 ド (123) + TX、セバジン (代替名) (725) + TX、クロルピシクレン (960
) + TX、クロルダン (128) + TX、クロルデコン (963) + TX、クロルジメホ
 ルム (964) + TX、クロルジメホルムヒドロクロリド (964) + TX、クロルエト
 キシホス (129) + TX、クロルフェナピル (130) + TX、クロルフェンビンホス
 (131) + TX、クロルフルアズロン (132) + TX、クロルメホス (136) + T
 X、クロロホルム [CCN] + TX、クロルピクリン (141) + TX、クロルホキシム

10

20

30

40

50

(9 8 9) + T X、クロルブラゾホス (9 9 0) + T X、クロルピリホス (1 4 5) + T X、クロルピリホスメチル (1 4 6) + T X、クロルチオホス (9 9 4) + T X、クロマフェノジド (1 5 0) + T X、シネリン I (6 9 6) + T X、シネリン II (6 9 6) + T X、シネリンス (6 9 6) + T X、cis - レスメスリン (代替名) + T X、シスメトリン (8 0) + T X、クロシトリン (代替名) + T X、クロエトカルブ (9 9 9) + T X、クロサンテル (代替名) [C C N] + T X、クロチアニジン (1 6 5) + T X、アセト亜ヒ酸銅 [C C N] + T X、ヒ酸銅 [C C N] + T X、オレイン酸銅 [C C N] + T X、クマホス (1 7 4) + T X、クミトエート (1 0 0 6) + T X、クロタミトン (代替名) [C C N] + T X、クロトキシホス (1 0 1 0) + T X、クルホメート (1 0 1 1) + T X、氷晶石 (代替名) (1 7 7) + T X、CS 7 0 8 (開発コード) (1 0 1 2) + T X、シアノフェンホス (1 0 1 9) + T X、シアノホス (1 8 4) + T X、シアントエート (1 0 2 0) + T X、シクレトリン [C C N] + T X、シクロプロトリン (1 8 8) + T X、シフルトリン (1 9 3) + T X、シハロトリン (1 9 6) + T X、シペルメトリン (2 0 1) + T X、シフェノトリン (2 0 6) + T X、シロマジン (2 0 9) + T X、シチオエート (代替名) [C C N] + T X、d - リモネン (代替名) [C C N] + T X、d - テトラメトリン (代替名) (7 8 8) + T X、DAEP (1 0 3 1) + T X、ダゾメット (2 1 6) + T X、DDT (2 1 9) + T X、デカルボフラン (1 0 3 4) + T X、デルタメトリン (2 2 3) + T X、デメフィオン (1 0 3 7) + T X、デメフィオン - O (1 0 3 7) + T X、デメフィオン - S (1 0 3 7) + T X、デメトン (1 0 3 8) + T X、デメトンメチル (2 2 4) + T X、デメトン - O (1 0 3 8) + T X、デメトン - O - メチル (2 2 4) + T X、デメトン - S (1 0 3 8) + T X、デメトン - S - メチル (2 2 4) + T X、デメトン - S - メチルスルホン (1 0 3 9) + T X、ジアフェンチウロン (2 2 6) + T X、ジアリホス (1 0 4 2) + T X、ジアミダホス (1 0 4 4) + T X、ダイアジノン (2 2 7) + T X、ジカプトン (1 0 5 0) + T X、ジクロロフェンチオン (1 0 5 1) + T X、ジクロルボス (2 3 6) + T X、ジクリホス (代替名) + T X、ジクレシル (代替名) [C C N] + T X、ジクロトホス (2 4 3) + T X、ジシクラニル (2 4 4) + T X、ディルドリン (1 0 7 0) + T X、ジエチル 5 - メチルピラゾール - 3 - イルリン酸 (IUPAC 名) (1 0 7 6) + T X、ジフルベンズロン (2 5 0) + T X、ジロール (代替名) [C C N] + T X、ジメフルトリン [C C N] + T X、ジメホクス (1 0 8 1) + T X、ジメタン (1 0 8 5) + T X、ジメトエート (2 6 2) + T X、ジメトリン (1 0 8 3) + T X、ジメチルピンホス (2 6 5) + T X、ジメチラン (1 0 8 6) + T X、ジネクス (1 0 8 9) + T X、ジネクスジクレキシ (1 0 8 9) + T X、ジノプロブ (1 0 9 3) + T X、ジノサム (1 0 9 4) + T X、ジノセブ (1 0 9 5) + T X、ジノテフラン (2 7 1) + T X、ジオフェノラン (1 0 9 9) + T X、ジオキサベンゾホス (1 1 0 0) + T X、ジオキサカルブ (1 1 0 1) + T X、ジオキサチオン (1 1 0 2) + T X、ジスルホトン (2 7 8) + T X、ジチクロホス (1 1 0 8) + T X、DNOC (2 8 2) + T X、ドラメクチン (代替名) [C C N] + T X、DSP (1 1 1 5) + T X、エクジステロン (代替名) [C C N] + T X、EI 1 6 4 2 (開発コード) (1 1 1 8) + T X、エマメクチン (2 9 1) + T X、エマメクチン安息香酸塩 (2 9 1) + T X、EMPC (1 1 2 0) + T X、エムベントリン (2 9 2) + T X、エンドスルファン (2 9 4) + T X、エンドチオン (1 1 2 1) + T X、エンドリン (1 1 2 2) + T X、EPBP (1 1 2 3) + T X、EPN (2 9 7) + T X、エポフェノナン (1 1 2 4) + T X、エピリノメクチン (代替名) [C C N] + T X、エスフェンバレレート (3 0 2) + T X、エタホス (代替名) [C C N] + T X、エチオフエンカルブ (3 0 8) + T X、エチオン (3 0 9) + T X、エチプロール (3 1 0) + T X、エトエートメチル (1 1 3 4) + T X、エトプロホス (3 1 2) + T X、ギ酸エチル (IUPAC 名) [C C N] + T X、エチル - DDD (代替名) (1 0 5 6) + T X、エチレンジプロミド (3 1 6) + T X、ジクロロエタン (化学名) (1 1 3 6) + T X、エチレンオキシド [C C N] + T X、エトフェンブロックス (3 1 9) + T X、エトリムホス (1 1 4 2) + T X、EXD (1 1 4 3) + T X、ファンファー (3 2 3) + T X、フェナミホス (3 2 6) + T X

10

20

30

40

50

、フェナザフロル(1147)+TX、フェンクロルホス(1148)+TX、フェネタカルブ(1149)+TX、フェンフルトリン(1150)+TX、フェニトロチオン(335)+TX、フェノブカルブ(336)+TX、フェノキサクリム(1153)+TX、フェノキシカルブ(340)+TX、フェンピリトリン(1155)+TX、フェンプロパトリン(342)+TX、フェンピラド(代替名)+TX、フェンスルホチオン(1158)+TX、フェンチオン(346)+TX、フェンチオンエチル[CCN]+TX、フェンバレレート(349)+TX、フィブロンル(354)+TX、フロニカミド(358)+TX、フルベンジアミド(CAS登録番号:272451-65-7)+TX、フルコフロン(1168)+TX、フルシクロクロスロン(366)+TX、フルシトリネート(367)+TX、フルエネチル(1169)+TX、フルフェネリム[CCN]+TX、フルフェノクスロン(370)+TX、フルフェンブロックス(1171)+T

10

X、フルメトリン(372)+TX、フルバリネート(1184)+TX、FMC1137(開発コード)(1185)+TX、フォノホス(1191)+TX、ホルメタネート(405)+TX、ホルメタネートヒドロクロリド(405)+TX、ホルモチオン(1192)+TX、ホルムパラネート(1193)+TX、ホスメチラン(1194)+TX、ホスピレート(1195)+TX、ホスチアゼート(408)+TX、ホスチエタン(1196)+TX、フラチオカルブ(412)+TX、フレトリン(1200)+TX、 γ -シハロトリン(197)+TX、 γ -HCH(430)+TX、グアザチン(422)+TX、グアザチン酢酸塩(422)+TX、GY-81(開発コード)(423)+TX、ハルフェンブロックス(424)+TX、ハロフェノジド(425)+TX、HCH(430)+TX、HEOD(1070)+TX、ヘプタクロル(1211)+TX、ヘプテノホス(432)+TX、ヘテロホス[CCN]+TX、ヘキサフルムロン(439)+TX、HHDN(864)+TX、ヒドラメチルノン(443)+TX、シアン化水素(444)+TX、ヒドロブレン(445)+TX、ヒキンカルブ(1223)+TX、イミダクロブリド(458)+TX、イミプロトリン(460)+TX、インドキサカルブ(465)+TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542)+TX、IPSP(1229)+TX、イサゾホス(1231)+TX、イソベンザン(1232)+TX、イソカルボホス(代替名)(473)+TX、イソドリン(1235)+TX、イソフェンホス(1236)+TX、イソラン(1237)+TX、イソプロカルブ(472)+TX、イソプロピルO-(メトキシアミノチオホスホリル)サリチレート(IUPAC名)(473)+TX、イソプロチオラン(474)+TX、イソチオエート(1244)+TX、イソキサチオン(480)+TX、イベルメクチン(代替名)[CCN]+TX、ジャスモリンI(696)+TX、ジャスモリンII(696)+TX、ジヨドフェンホス(1248)+TX、幼虫ホルモンI(代替名)[CCN]+TX、幼虫ホルモンII(代替名)[CCN]+TX、ケレバン(1249)+TX、キノブレン(484)+TX、 λ -シハロトリン(198)+TX、砒酸鉛[CCN]+TX、レピメクチン(CCN)+TX、レプトホス(1250)+TX、リンダン(430)+TX、リリムホス(1251)+TX、ルフェヌロン(490)+TX、リチダチオン(1253)+TX、m-クメニルメチルカルバメート(IUPAC名)(1014)+TX、リン化マグネシウム(IUPAC名)(640)+TX、マラチオン(492)+TX、マロノベン(1254)+TX、マジドクス(1255)+TX、メカルバム(502)+TX、メカルホン(1258)+TX、メナゾン(1260)+TX、メホスフォラン(1261)+TX、塩化第一水銀(513)+TX、メスルフェンホス(1263)+TX、メタフルミゾン(CCN)+TX、メタム(519)+TX、メタムカリウム(代替名)(519)+TX、メタムナトリウム(519)+TX、メタクリホス(1266)+TX、メタミドホス(527)+TX、ノルニコチン(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1268)+TX、メチダチオン(529)+TX、メチオカルブ(530)+TX、メトクロトホス(1273)+TX、メソミル(531)+TX、メトブレン(532)+TX、メトキンブチ

20

30

40

50

ル(1276)+TX、メトトリン(代替名)(533)+TX、メトキシクロル(534)+TX、メトキシフェノジド(535)+TX、臭化メチル(537)+TX、メチルイソチオシアネート(543)+TX、メチルククロホルム(代替名)[CCN]+TX、塩化メチレン[CCN]+TX、メトフルトリン[CCN]+TX、メトルカルブ(550)+TX、メトキサジアゾン(1288)+TX、メピンホス(556)+TX、メキサカルベート(1290)+TX、ミルベメクチン(557)+TX、ミルマイシンオキシム(代替名)[CCN]+TX、ミパホクス(1293)+TX、ミレックス(1294)+TX、モノクロトホス(561)+TX、モルホチオン(1300)+TX、モキシデクチン(代替名)[CCN]+TX、ナフタロホス(代替名)[CCN]+TX、ナレド(567)+TX、ナフタレン(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1303)+TX、NC-170(開発コード)(1306)+TX、NC-184(化合物コード)+TX、ニコチン(578)+TX、ニコチンスルフェート(578)+TX、ニフルリジド(1309)+TX、ニテンピラム(579)+TX、ニチアジン(1311)+TX、ニトリラカルブ(1313)+TX、ニトリラカルブ1:1塩化亜鉛錯体(1313)+TX、NNI-0101(化合物コード)+TX、NNI-0250(化合物コード)+TX、ノルニコチン(慣習名)(1319)+TX、ノバルロン(585)+TX、ノビフルムロン(586)+TX、O-5-ジクロロ-4-ヨードフェニルO-エチルエチルホスホノチオエート(IUPAC名)(1057)+TX、O,O-ジエチルO-4-メチル-2-オキソ-2H-クロメン-7-イルホスホロチオネート(IUPAC名)(1074)+TX、O,O-ジエチルO-6-メチル-2-プロピルピリミジン-4-イルホスホロチオネート(IUPAC名)(1075)+TX、O,O,O',O'-テトラプロピルジチオピロホスフェート(IUPAC名)(1424)+TX、オレイン酸(IUPAC名)(593)+TX、オメトエート(594)+TX、オキサミル(602)+TX、オキシデメトンメチル(609)+TX、オキシデプロホス(1324)+TX、オキシジスルホトン(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、パラ-ジクロロベンゼン[CCN]+TX、パラチオン(615)+TX、パラチオンメチル(616)+TX、ペンフルロン(代替名)[CCN]+TX、ペンタクロロフェノール(623)+TX、ラウリン酸ペンタクロロフェニル(IUPAC名)(623)+TX、ペルメトリン(626)+TX、石油(代替名)(628)+TX、PH60-38(開発コード)(1328)+TX、フェンカプトン(1330)+TX、フェノトリン(630)+TX、フェントエート(631)+TX、ホレート(636)+TX、ホサロン(637)+TX、ホスホラン(1338)+TX、ホスメット(638)+TX、ホスニクロル(1339)+TX、ホスファミドン(639)+TX、ホスフィン(IUPAC名)(640)+TX、ホキシム(642)+TX、ホキシムメチル(1340)+TX、ピリメタホス(1344)+TX、ピリミカーブ(651)+TX、ピリミホスエチル(1345)+TX、ピリミホスメチル(652)+TX、ポリクロロジシクロペンタジエン異性体(IUPAC名)(1346)+TX、ポリクロロテルペン(慣習名)(1347)+TX、亜ヒ酸カリウム[CCN]+TX、カリウムチオシアネート[CCN]+TX、プラレトリン(655)+TX、プレコセンI(代替名)[CCN]+TX、プレコセンII(代替名)[CCN]+TX、プレコセンIII(代替名)[CCN]+TX、プリミドホス(1349)+TX、プロフェノホス(662)+TX、プロフルトリン[CCN]+TX、プロマシル(1354)+TX、プロメカルブ(1355)+TX、プロパホス(1356)+TX、プロペタムホス(673)+TX、プロボキスル(678)+TX、プロチダチオン(1360)+TX、プロチオホス(686)+TX、プロトエート(1362)+TX、プロトリフェンブト[CCN]+TX、ピメトロジン(688)+TX、ピラクロホス(689)+TX、ピラゾホス(693)+TX、ピレスメトリン(1367)+TX、ピレトリンI(696)+TX、ピレトリンII(696)+TX、ピレトリン(696)+TX、ピリダベン(699)+TX、ピリダリル(700)+TX、ピリダフェンチオン(701)+TX、ピリミジフェン(706)+TX、ピリミテート(1370)+TX、ピリプロキシフェン

(708) + TX、カッシア(代替名) [CCN] + TX、キナルホス(711) + TX、キナルホスメチル(1376) + TX、キノチオン(1380) + TX、キンチオホス(1381) + TX、R-1492(開発コード)(1382) + TX、ラホキサニド(代替名) [CCN] + TX、レスメスリン(719) + TX、ロテノン(722) + TX、RU15525(開発コード)(723) + TX、RU25475(開発コード)(1386) + TX、リアニア(代替名)(1387) + TX、リアノジン(慣習名)(1387) + TX、サバジラ(代替名)(725) + TX、シュラダン(1389) + TX、セブホス(代替名) + TX、セラメクチン(代替名) [CCN] + TX、SI-0009(化合物コード) + TX、SI-0205(化合物コード) + TX、SI-0404(化合物コード) + TX、SI-0405(化合物コード) + TX、シラフルオフエン(728) + TX、SN72129(開発コード)(1397) + TX、亜ヒ酸ナトリウム [CCN] + TX、シアン化ナトリウム(444) + TX、ナトリウムフッ化物(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1399) + TX、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム(1400) + TX、ペンタクロロフェノキシドナトリウム塩(623) + TX、セレン酸ナトリウム(IUPAC名)(1401) + TX、チオシアン酸ナトリウム [CCN] + TX、ソファミド(1402) + TX、スピノサド(737) + TX、スピロメシフェン(739) + TX、スピロテトラマト(CCN) + TX、スルコフロン(746) + TX、スルコフロンナトリウム(746) + TX、スルフラミド(750) + TX、スルホテブ(753) + TX、スルフリルフッ化物(756) + TX、スルプロホス(1408) + TX、タール油(代替名)(758) + TX、 τ -フルバリネート(398) + TX、チオナジン(1412) + TX、TDE(1414) + TX、テブフェノジド(762) + TX、テブフェンピラド(763) + TX、テブピリムホス(764) + TX、テフルベンズロン(768) + TX、テフルトリン(769) + TX、テメホス(770) + TX、TEPP(1417) + TX、テラレスリン(1418) + TX、テルバム(代替名) + TX、テルブホス(773) + TX、テトラクロロエタン [CCN] + TX、テトラクロロルピンホス(777) + TX、テトラメトリン(787) + TX、 θ -シベルメトリン(204) + TX、チアクロブリド(791) + TX、チアフェノクス(代替名) + TX、チアメトキサム(792) + TX、チクロホス(1428) + TX、チオカルボキシム(1431) + TX、チオシクラム(798) + TX、チオシクラム水素オキサレート(798) + TX、チオジカルブ(799) + TX、チオフアノックス(800) + TX、チオメトン(801) + TX、チオナジン(1434) + TX、チオスルタップ(803) + TX、チオスルタップナトリウム(803) + TX、ツリンギエンシン(代替名) [CCN] + TX、トルフェンピラド(809) + TX、トラロメトリン(812) + TX、トランスフルトリン(813) + TX、トランスパーメトリン(1440) + TX、トリアミホス(1441) + TX、トリアザメート(818) + TX、トリアゾホス(820) + TX、トリアズロン(代替名) + TX、トリクロルホン(824) + TX、トリクロルメタホス-3(代替名) [CCN] + TX、トリクロロナト(1452) + TX、トリフェノホス(1455) + TX、トリフルムロン(835) + TX、トリメタカルブ(840) + TX、トリブレン(1459) + TX、バミドチオン(847) + TX、バニリプロール [CCN] + TX、ベラトリジン(代替名)(725) + TX、ベラトリン(代替名)(725) + TX、XMC(853) + TX、キシリルカルブ(854) + TX、YI-5302(化合物コード) + TX、 ζ -シベルメトリン(205) + TX、 ζ メトリン(代替名) + TX、亜鉛ホスフィド(640) + TX、ゾラプロホス(1469) および ZXI8901(開発コード)(858) + TX、シアントラニリプロール [736994-63-19] + TX、クロラントラニリプロール [500008-45-7] + TX、シエノピラフェン [560121-52-0] + TX、シフルメトフェン [400882-07-7] + TX、ピリフルキナゾン [337458-27-2] + TX、スピネトラム [187166-40-1 + 187166-15-0] + TX、スピロテトラマト [203313-25-1] + TX、スルホキサフロル [946578

- 00 - 3] + TX、フルフィプロール [704886 - 18 - 0] + TX、メベルフル
トリン [915288 - 13 - 0] + TX、テトラメチルフルトリン [84937 - 88
- 2] + TX、トリフルメゾピリム (国際公開第 2012 / 092115 号パンフレット
に開示されている) + TX から構成される物質群から選択される殺虫剤、

ビス (トリブチルスズ) オキシド (IUPAC 名) (913) + TX、ブromoアセタミド
[CCN] + TX、ヒ酸カルシウム [CCN] + TX、クロエトカルブ (999) + TX
、アセト亜ヒ酸銅 [CCN] + TX、硫酸銅 (172) + TX、フェンチン (347) +
TX、第二鉄リン酸 (IUPAC 名) (352) + TX、メタアルデヒド (518) + T
X、メチオカルブ (530) + TX、ニクロスアミド (576) + TX、ニクロスアミド
オラミン (576) + TX、ペンタクロロフェノール (623) + TX、ペンタクロロフ
エノキシドナトリウム塩 (623) + TX、チオナジン (1412) + TX、チオジカル
ブ (799) + TX、酸化トリブチルスズ (913) + TX、トリフェンモルフ (145
4) + TX、トリメタカルブ (840) + TX、酢酸トリフェニルスズ (IUPAC 名)
(347) および水酸化トリフェニルスズ (IUPAC 名) (347) + TX、ピリプロ
ール [394730 - 71 - 3] + TX から構成される物質群から選択される殺軟体動物
剤、

AKD - 3088 (化合物コード) + TX、1, 2 - ジブromo - 3 - クロロプロパン (I
UPAC / Chemical Abstracts 名) (1045) + TX、1, 2 - ジ
クロロプロパン (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (1062)
+ TX、1, 2 - ジクロロプロパンを伴う 1, 3 - ジクロロプロペン (IUPAC 名) (1063) + TX、1, 3 - ジクロロプロペン (233) + TX、3, 4 - ジクロロテ
ラヒドロチオフェン 1, 1 - ジオキシド (IUPAC / Chemical Abstracts 名) (1065) + TX、3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチルロダニン (I
UPAC 名) (980) + TX、5 - メチル - 6 - チオキソ - 1, 3, 5 - チアジアジナ
ン - 3 - イル酢酸 (IUPAC 名) (1286) + TX、6 - イソペンテニルアミノプリ
ン (代替名) (210) + TX、アバメクチン (1) + TX、アセトプロール [CCN]
+ TX、アラニカルブ (15) + TX、アルジカルブ (16) + TX、アルドキシカルブ
(863) + TX、AZ60541 (化合物コード) + TX、ベンクロチアズ [CCN]
+ TX、ベノミル (62) + TX、ブチルピリダベン (代替名) + TX、カズサホス (1
09) + TX、カルボフラン (118) + TX、二硫化炭素 (945) + TX、カルボス
ルファン (119) + TX、クロルピクリン (141) + TX、クロルピリホス (145
) + TX、クロエトカルブ (999) + TX、サイトカイニン (代替名) (210) + T
X、ダゾメット (216) + TX、DBCP (1045) + TX、DCIP (218) +
TX、ジアミダホス (1044) + TX、ジクロロフェンチオン (1051) + TX、ジ
クリホス (代替名) + TX、ジメトエート (262) + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、エマメクチン (291) + TX、エマメクチン安息香酸塩 (291) +
TX、エピリノメクチン (代替名) [CCN] + TX、エトプロホス (312) + TX、
エチレンジブromid (316) + TX、フェナミホス (326) + TX、フェンピラド (代替名) + TX、フェンスルホチオン (1158) + TX、ホスチアゼート (408) +
TX、ホスチエタン (1196) + TX、ルフラール (代替名) [CCN] + TX、GY
- 81 (開発コード) (423) + TX、ヘテロホス [CCN] + TX、ヨードメタン (I
UPAC 名) (542) + TX、イサミドホス (1230) + TX、イサゾホス (12
31) + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、カイネチン (代替名) (2
10) + TX、メカルホン (1258) + TX、メタム (519) + TX、メタムカリウ
ム (代替名) (519) + TX、メタムナトリウム (519) + TX、臭化メチル (53
7) + TX、メチルイソチオシアネート (543) + TX、ミルベマイシンオキシム (代
替名) [CCN] + TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] + TX、ミロテシウムベ
ルカリア (Myrothecium verrucaria) 組成物 (代替名) (565) + TX、NC - 184 (化合物コード) + TX、オキサミル (602) + TX、ホレー
ト (636) + TX、ホスファミドン (639) + TX、ホスホカルブ [CCN] + TX

10

20

30

40

50

、セブホス（代替名）+TX、セラメクチン（代替名）[CCN]+TX、スピノサド（737）+TX、テルバム（代替名）+TX、テルブホス（773）+TX、テトラクロロチオフェン（IUPAC/Chemical Abstracts名）（1422）+TX、チアフエノクス（代替名）+TX、チオナジン（1434）+TX、トリアゾホス（820）+TX、トリアズロン（代替名）+TX、キシレノルス[CCN]+TX、YI-5302（化合物コード）およびゼアチン（代替名）（210）+TX、フルエンスルホン[318290-98-1]+TXから構成される物質群から選択される殺線虫剤、

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

10

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

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

20

30

2-（2-プトキシエトキシ）-エチルピペロニレート（IUPAC名）（934）+TX、5-（1,3-ベンゾジオキソール-5-イル）-3-ヘキシルシクロヘキサ-2-エノン（IUPAC名）（903）+TX、ファルネソールを伴うネオリドール（代替名）（324）+TX、MB-599（開発コード）（498）+TX、MGK264（開発コード）（296）+TX、ピペロニルプトキシド（649）+TX、ピプロタル（1343）+TX、プロピル異性体（1358）+TX、S421（開発コード）（724）+TX、セサメックス（1393）+TX、セサモリン（1394）およびスルホキシド（1406）+TXから構成される物質群から選択される共力剤、

40

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

50

される動物忌避剤、

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

酸化水銀（ I I ）（ 5 1 2 ） + T X 、 オクチリノン（ 5 9 0 ） およびチオファネートメチル（ 8 0 2 ） + T X から構成される物質群から選択される創傷保護剤、

ならびに、アザコナゾール（ 6 0 2 0 7 - 3 1 - 0 ） + T X 、 ビテルタノール [7 0 5 8 5 - 3 6 - 3] + T X 、 プロムコナゾール [1 1 6 2 5 5 - 4 8 - 2] + T X 、 シプロコナゾール [9 4 3 6 1 - 0 6 - 5] + T X 、 ジフェンコナゾール [1 1 9 4 4 6 - 6 8 - 3] + T X 、 ジニコナゾール [8 3 6 5 7 - 2 4 - 3] + T X 、 エポキシコナゾール [1 0 6 3 2 5 - 0 8 - 0] + T X 、 フェンブコナゾール [1 1 4 3 6 9 - 4 3 - 6] + T X

10

、フルキンコナゾール [1 3 6 4 2 6 - 5 4 - 5] + T X 、 フルシラゾール [8 5 5 0 9 - 1 9 - 9] + T X 、 フルトリアホル [7 6 6 7 4 - 2 1 - 0] + T X 、 ヘキサコナゾール [7 9 9 8 3 - 7 1 - 4] + T X 、 イマザリル [3 5 5 5 4 - 4 4 - 0] + T X 、 イミベンコナゾール [8 6 5 9 8 - 9 2 - 7] + T X 、 イブコナゾール [1 2 5 2 2 5 - 2 8 - 7] + T X 、 メトコナゾール [1 2 5 1 1 6 - 2 3 - 6] + T X 、 ミクロブタニル [8 8 6 7 1 - 8 9 - 0] + T X 、 ペフラゾエート [1 0 1 9 0 3 - 3 0 - 4] + T X 、 ペンコナゾール [6 6 2 4 6 - 8 8 - 6] + T X 、 プロチオコナゾール [1 7 8 9 2 8 - 7 0 - 6] + T X 、 ピリフェノックス [8 8 2 8 3 - 4 1 - 4] + T X 、 プロクロラズ [6 7 7 4 7 - 0 9 - 5] + T X 、 プロピコナゾール [6 0 2 0 7 - 9 0 - 1] + T X 、 シメコナゾール [1 4 9 5 0 8 - 9 0 - 7] + T X 、 テブコナゾール [1 0 7 5 3 4 - 9 6 - 3] + T X 、 テトラコナゾール [1 1 2 2 8 1 - 7 7 - 3] + T X 、 トリアジメホン [4 3 1 2 1 - 4 3 - 3] + T X 、 トリアジメノール [5 5 2 1 9 - 6 5 - 3] + T X 、 トリフルミゾール [9 9 3 8 7 - 8 9 - 0] + T X 、 トリチコナゾール [1 3 1 9 8 3 - 7 2 - 7] + T X 、 アンシミドール [1 2 7 7 1 - 6 8 - 5] + T X 、 フェナリモル [6 0 1 6 8 - 8 8 - 9] + T X 、 ヌアリモル [6 3 2 8 4 - 7 1 - 9] + T X 、 ブピリメート [4 1 4 8 3 - 4 3 - 6] + T X 、 ジメチリモール [5 2 2 1 - 5 3 - 4] + T X 、 エチリモール [2 3 9 4 7 - 6 0 - 6] + T X 、 ドデモルフ [1 5 9 3 - 7 7 - 7] + T X 、 フェンプロピジン [6 7 3 0 6 - 0 0 - 7] + T X 、 フェンプロピモルフ [6 7 5 6 4 - 9 1 - 4] + T X 、 スピロキサミン [1 1 8 1 3 4 - 3 0 - 8] + T X 、 トリデモルフ [8 1 4 1 2 - 4 3 - 3] + T X 、 シプロジニル [1 2 1 5 5 2 - 6 1 - 2] + T X 、 メバニピリム [1 1 0 2 3 5 - 4 7 - 7] + T X 、 ピリメタニル [5 3 1 1 2 - 2 8 - 0] + T X 、 フェンピクロニル [7 4 7 3 8 - 1 7 - 3] + T X 、 フルジオキシニル [1 3 1 3 4 1 - 8 6 - 1] + T X 、 ベナラキシル [7 1 6 2 6 - 1 1 - 4] + T X 、 フララキシル [5 7 6 4 6 - 3 0 - 7] + T X 、 メタラキシル [5 7 8 3 7 - 1 9 - 1] + T X 、 R - メタラキシル [7 0 6 3 0 - 1 7 - 0] + T X 、 オフレース [5 8 8 1 0 - 4 8 - 3] + T X 、 オキサジキシル [7 7 7 3 2 - 0 9 - 3] + T X 、 ベノミル [1 7 8 0 4 - 3 5 - 2] + T X 、 カルベンダジム [1 0 6 0 5 - 2 1 - 7] + T X 、 デバカルブ [6 2 7 3 2 - 9 1 - 6] + T X 、 フベリダゾール [3 8 7 8 - 1 9 - 1] + T X 、 チアベンダゾール [1 4 8 - 7 9 - 8] + T X 、 クロゾリネート [8 4 3 3 2 - 8 6 - 5] + T X 、 ジクロゾリン [2 4 2 0 1 - 5 8 - 9] + T X 、 イブプロジオン [3 6 7 3 4 - 1 9 - 7] + T X 、

20

ミクロゾリン [5 4 8 6 4 - 6 1 - 8] + T X 、 プロシミドン [3 2 8 0 9 - 1 6 - 8] + T X 、 ピンクロゾリン [5 0 4 7 1 - 4 4 - 8] + T X 、 ポスカリド [1 8 8 4 2 5 - 8 5 - 6] + T X 、 カルボキシシン [5 2 3 4 - 6 8 - 4] + T X 、 フェンフラム [2 4 6 9 1 - 8 0 - 3] + T X 、 フルトラニル [6 6 3 3 2 - 9 6 - 5] + T X 、 メプロニル [5 5 8 1 4 - 4 1 - 0] + T X 、 オキシカルボキシシン [5 2 5 9 - 8 8 - 1] + T X 、 ペンチオピラド [1 8 3 6 7 5 - 8 2 - 3] + T X 、 チフルザミド [1 3 0 0 0 0 - 4 0 - 7] + T X 、 グアザチン [1 0 8 1 7 3 - 9 0 - 6] + T X 、 ドジン [2 4 3 9 - 1 0 - 3] [1 1 2 - 6 5 - 2] （ 遊離塩基 ） + T X 、 イミノクタジン [1 3 5 1 6 - 2 7 - 3] + T X 、 アゾキシストロピン [1 3 1 8 6 0 - 3 3 - 8] + T X 、 ジモキシストロピン [1 4 9 9 6 1 - 5 2 - 4] + T X 、 エネストロピン { P r o c . B C P C , I n t . C

30

40

50

ongr., Glasgow, 2003, 1, 93} + TX、フルオキサストロピン [3
61377 - 29 - 9] + TX、クレソキシムメチル [143390 - 89 - 0] + TX
、メトミノストロピン [133408 - 50 - 1] + TX、トリフロキシストロピン [1
41517 - 21 - 7] + TX、オリザストロピン [248593 - 16 - 0] + TX、
ピコキシストロピン [117428 - 22 - 5] + TX、ピラクロストロピン [1750
13 - 18 - 0] + TX、フェルバム [14484 - 64 - 1] + TX、マンコゼブ [8
018 - 01 - 7] + TX、マンネブ [12427 - 38 - 2] + TX、メチラム [90
06 - 42 - 2] + TX、プロピネブ [12071 - 83 - 9] + TX、チラム [137
- 26 - 8] + TX、ジネブ [12122 - 67 - 7] + TX、ジラム [137 - 30 -
4] + TX、カプタホール [2425 - 06 - 1] + TX、キャプタン [133 - 06 -
2] + TX、ジクロフルアニド [1085 - 98 - 9] + TX、フルオロイミド [412
05 - 21 - 4] + TX、ホルベット [133 - 07 - 3] + TX、トリルフルアニド [731 - 27 - 1] + TX、ボルドー液 [8011 - 63 - 0] + TX、水酸化銅 (I I) [20427 - 59 - 2] + TX、塩化銅 [1332 - 40 - 7] + TX、硫酸銅 [7758 - 98 - 7] + TX、酸化銅 (I I) [1317 - 39 - 1] + TX、マンカップ
ー [53988 - 93 - 5] + TX、オキシ銅 [10380 - 28 - 6] + TX、ジノ
カップ [131 - 72 - 6] + TX、ニトロタルイソプロピル [10552 - 74 - 6]
+ TX、エディフェンホス [17109 - 49 - 8] + TX、イプロベンホス [2608
7 - 47 - 8] + TX、イソプロチオラン [50512 - 35 - 1] + TX、ホスジフェ
ン [36519 - 00 - 3] + TX、ピラゾホス [13457 - 18 - 6] + TX、トル
コホスメチル [57018 - 04 - 9] + TX、アシベンゾラル - S - メチル [1351
58 - 54 - 2] + TX、アニラジン [101 - 05 - 3] + TX、ベンチアバリカルブ
[413615 - 35 - 7] + TX、プラストサイジン - S [2079 - 00 - 7] + T
X、チノメチオナート [2439 - 01 - 2] + TX、クロロネブ [2675 - 77 - 6
] + TX、クロロタロニル [1897 - 45 - 6] + TX、シフルフェナミド [1804
09 - 60 - 3] + TX、シモキサニル [57966 - 95 - 7] + TX、ジクロン [1
17 - 80 - 6] + TX、ジクロシメット [139920 - 32 - 4] + TX、ジクロメ
ジン [62865 - 36 - 5] + TX、ジクロラン [99 - 30 - 9] + TX、ジエトフ
エンカルブ [87130 - 20 - 9] + TX、ジメトモルフ [110488 - 70 - 5]
+ TX、SYP - LI90 (フルモルフ) [211867 - 47 - 9] + TX、ジチアノ
ン [3347 - 22 - 6] + TX、エタボキサム [162650 - 77 - 3] + TX、エ
トリジアゾール [2593 - 15 - 9] + TX、ファモキサドン [131807 - 57 -
3] + TX、フェンアミドン [161326 - 34 - 7] + TX、フェノキサニル [11
5852 - 48 - 7] + TX、フェンチン [668 - 34 - 8] + TX、フェリムゾン [89269 - 64 - 7] + TX、フルアジナム [79622 - 59 - 6] + TX、フルオ
ピコリド [239110 - 15 - 7] + TX、フルスルファミド [106917 - 52 -
6] + TX、フェンヘキサミド [126833 - 17 - 8] + TX、ホセチルアルミニウ
ム [39148 - 24 - 8] + TX、ヒメキサゾール [10004 - 44 - 1] + TX、
イプロバリカルブ [140923 - 17 - 7] + TX、IKF - 916 (シアゾファミド
) [120116 - 88 - 3] + TX、カスガマイシン [6980 - 18 - 3] + TX、
メタスルホカルブ [66952 - 49 - 6] + TX、メトラフェノン [220899 - 0
3 - 6] + TX、ペンシクロン [66063 - 05 - 6] + TX、フタリド [27355
- 22 - 2] + TX、ポリオキシシン [11113 - 80 - 7] + TX、プロベナゾール [27605 - 76 - 1] + TX、プロパモカルブ [25606 - 41 - 1] + TX、プロ
キナジド [189278 - 12 - 4] + TX、ピロキロン [57369 - 32 - 1] + T
X、キノキシフェン [124495 - 18 - 7] + TX、キントゼン [82 - 68 - 8]
+ TX、スルフル [7704 - 34 - 9] + TX、チアジニル [223580 - 51 - 6
] + TX、トリアゾキシド [72459 - 58 - 6] + TX、トリシクラゾール [418
14 - 78 - 2] + TX、トリホリン [26644 - 46 - 2] + TX、バリダマイシン
[37248 - 47 - 8] + TX、ゾキサミド (RH7281) [156052 - 68 -

10

20

30

40

50

5] + T X、マンジプロパミド [3 7 4 7 2 6 - 6 2 - 2] + T X、イソピラザム [8 8 1 6 8 5 - 5 8 - 1] + T X、セダキサン [8 7 4 9 6 7 - 6 7 - 6] + T X、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (9 - ジクロロメチレン - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノンナフタレン - 5 - イル) - アミド (国際公開第 2 0 0 7 / 0 4 8 5 5 6 号パンフレットに開示されている) + T X、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (3 ' , 4 ' , 5 ' - トリフルオロ - ビフェニル - 2 - イル) - アミド (国際公開第 2 0 0 6 / 0 8 7 3 4 3 号パンフレットに開示されている) + T X、[(3 S , 4 R , 4 a R , 6 S , 6 a S , 1 2 R , 1 2 a S , 1 2 b S) - 3 - [(シクロプロピルカルボニル) オキシ] - 1 , 3 , 4 , 4 a , 5 , 6 , 6 a , 1 2 , 1 2 a , 1 2 b - デカヒドロ - 6 , 1 2 - ジヒドロキシ - 4 , 6 a , 1 2 b - トリメチル - 1 1 - オキソ - 9 - (3 - ピリジニル) - 2 H , 1 1 H ナフト [2 , 1 - b] ピラノ [3 , 4 - e] ピラン - 4 - イル] メチル - シクロプロパンカルボキシレート [9 1 5 9 7 2 - 1 7 - 7] + T X および 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - (2 - メチル - 1 - オキソプロピル) - N - [3 - (2 - メチルプロピル) - 4 - [2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - メトキシ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル] フェニル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド [9 2 6 9 1 4 - 5 5 - 8] + T X。

または、N - [(5 - クロロ - 2 - イソプロピル - フェニル) メチル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - ピラゾール - 4 - カルボキサミド + T X、2 , 6 - ジメチル - 1 H , 5 H - [1 , 4] ジチイノ [2 , 3 - c : 5 , 6 - c '] ジピロール - 1 , 3 , 5 , 7 (2 H , 6 H) - テトラオン + T X、4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロ - フェニル) - N - (2 - クロロ - 6 - フルオロ - フェニル) - 2 , 5 - ジメチル - ピラゾール - 3 - アミン + T X、3 - (ジフルオロメチル) - N - (7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - インダン - 4 - イル) - 1 - メチル - ピラゾール - 4 - カルボキサミド + T X、C A S 8 5 0 8 8 1 - 3 0 - 0 + T X、3 - (3 , 4 - ジクロロ - 1 , 2 - チアゾール - 5 - イルメトキシ) - 1 , 2 - ベンゾチアゾール 1 , 1 - ジオキシド + T X、2 - [2 - [(2 , 5 - ジメチルフェノキシ) メチル] フェニル] - 2 - メトキシ - N - メチル - アセトアミド + T X、3 - (4 , 4 - ジフルオロ - 3 , 4 - ジヒドロ - 3 , 3 - ジメチルイソキノリン - 1 - イル) キノロン + T X、2 - [2 - フルオロ - 6 - [(8 - フルオロ - 2 - メチル - 3 - キノリル) オキシ] フェニル] プロパン - 2 - オール + T X、オキサチアピプロリン + T X、t - ブチル N - [6 - [[(1 - メチルテトラゾール - 5 - イル) - フェニル - メチレン] アミノ] オキシメチル] - 2 - ピリジル] カルバメート + T X、N - [2 - (3 , 4 - ジフルオロフェニル) フェニル] - 3 - (トリフルオロメチル) ピラジン - 2 - カルボキサミド + T X、3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル] ピラゾール - 4 - カルボキサミド + T X、2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル N - [2 - メチル - 1 - [[(4 - メチルベンゾイル) アミノ] メチル] プロピル] カルバメート + T X、(2 R S) - 2 - [4 - (4 - c クロロフェノキシ) - α , α , α - トリフルオロ - o - トリル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール + T X、(2 R S) - 2 - [4 - (4 - c クロロフェノキシ) - α , α , α - トリフルオロ - o - トリル] - 3 - メチル - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール + T X、2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 R) - 3 - エチル - 1 , 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + T X、N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - フェノキシ - フェニル) - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + T X、N ' - [4 - (4 , 5 - ジクロロチアゾール - 2 - イル) オキシ - 2 , 5 - ジメチル - フェニル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + T X、[2 - [3 - [2 - [1 - [2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) ピラゾール - 1 - イル] アセチル] - 4 - ピペリジル] チアゾール - 4 - イル] - 4 , 5 - ジヒドロイソキサゾール - 5 - イル] - 3 - クロロ - フェニル] メタンスルホン酸 + T X、ブタ - 3 - イニル N - [6 - [[(Z) - [(1 - メチルテトラゾール - 5 - イル) - フェニル - メチレン] アミノ] オキシメチル] - 2 - ピリジル] カルバメート + T X、メチル N - [[5 - [4 -

10

20

30

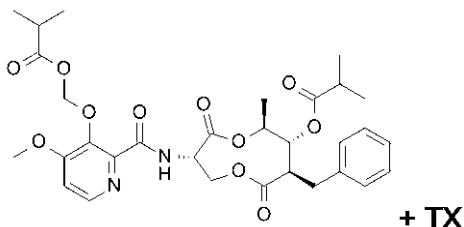
40

50

(2, 4 - ジメチルフェニル) トリアゾール - 2 - イル] - 2 - メチル - フェニル] メチル] カルバメート + TX、3 - クロロ - 6 - メチル - 5 - フェニル - 4 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) ピリダジン + TX、3 - クロロ - 4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 6 - メチル - 5 - フェニル - ピリダジン + TX、3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [1, 1, 3 - トリメチルインダン - 4 - イル] ピラゾール - 4 - カルボキサミド + TX、1 - [2 - [1 - (4 - クロロフェニル) ピラゾール - 3 - イル] オキシメチル] - 3 - メチル - フェニル] - 4 - メチル - テトラゾール - 5 - オン + TX、1 - メチル - 4 - [3 - メチル - 2 - [2 - メチル - 4 - (3, 4, 5 - トリメチルピラゾール - 1 - イル) フェノキシ] メチル] フェニル] テトラゾール - 5 - オン + TX および

10

【化 27】



からなる群から選択される生物学的に有効な化合物。

【0189】

20

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

30

【0190】

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

40

【0191】

A1 ~ A18 (上記) から選択される式 I の化合物と、上記の活性成分との活性成分混合物は、A1 ~ A18 (上記) から選択される化合物と、上記の活性成分とを、100 : 1 ~ 1 : 6000、特に 50 : 1 ~ 1 : 50、特に 20 : 1 ~ 1 : 20 の比、特に 10 : 1 ~ 1 : 10、特に 5 : 1 ~ 1 : 5 の混合比で含んでいることが好ましく、2 : 1 ~ 1 : 2 の比が特に好ましく、および、4 : 1 ~ 2 : 1 の比が同様に好ましく、とりわけ、1 :

50

1、または、5：1、または、5：2、または、5：3、または、5：4、または、4：1、または、4：2、または、4：3、または、3：1、または、3：2、または、2：1、または、1：5、または、2：5、または、3：5、または、4：5、または、1：4、または、2：4、または、3：4、または、1：3、または、2：3、または、1：2、または、1：600、または、1：300、または、1：150、または、1：35、または、2：35、または、4：35、または、1：75、または、2：75、または、4：75、または、1：6000、または、1：3000、または、1：1500、または、1：350、または、2：350、または、4：350、または、1：750、または、2：750、または、4：750の比が好ましい。これらの混合比は、重量比である。

10

【0192】

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

【0193】

A1～A18（上記）から選択される式Iの化合物と、上記の1種以上の活性成分とを含む混合物は、例えば、単一の「調合済み」形態で、単一の活性成分コンポーネントの個々の配合物から組成される「タンク混合物」などの複合型噴霧混合物で、および、逐次的（すなわち、数時間または数日間などの適度に短時間のうちに次々と）に適用される場合には単一の活性成分を併用して適用されることが可能である。A1～A18（上記）から選択される式Iの化合物と上記の活性成分を適用する順番は本発明の作用については重要ではない。

20

【0194】

本発明による組成物はまた、例えば末エポキシ化またはエポキシ化植物性油（例えばエポキシ化ココナツ油、ナタネ油またはダイズ油）といった安定化剤、例えばシリコーン油といった消泡剤、防腐剤、粘度調節剤、バインダおよび/もしくは粘着剤、肥料、または、特定の効果を達成するための他の活性成分、例えば殺菌剤（fungicide）、殺菌剤（bactericide）、抗線虫薬、植物活性化剤、殺軟体動物剤もしくは除草剤などのさらなる固体助剤もしくは液体助剤を含んでいることが可能である。

30

【0195】

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

【0196】

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

40

【0197】

本発明のさらなる態様は、作物植物、例えば種子といったその繁殖体、例えば収穫された食品作物といった収穫された作物などの例えば有用な植物といった植物、または、昆虫

50

、もしくは、特に菌性生物といった植物病原性もしくはヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物もしくは生物による非生体材料に係る外寄生を防除もしくは予防する方法に関し、この方法は、式Ⅰの化合物もしくは上記に定義されている好ましい個別の化合物を、活性成分として植物、植物の一部もしくはその生息地、その繁殖体、または、非生体材料のいずれかの部分に適用するステップを含む。

【0198】

防除もしくは予防とは、昆虫による、または、特に菌性生物といった植物病原性もしくはヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物もしくは生物による外寄生を、向上が実証されるレベルまで低減させることを意味する。

【0199】

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

【0200】

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

【0201】

流行している状況における意図される目的、および、上述の種類の有害生物を防除するための組成物の使用に適合するよう選択されるべきである、吹付け、噴霧、散粉、はけ塗り、粉衣、拡散または流しかけなどの上述の種類の有害生物の防除方法である組成物の適用方法が本発明の他の主題である。典型的な濃度割合は、0.1～1000 ppm、好ましくは0.1～500 ppmの活性成分である。1ヘクタール当たりの適用量は、好ましくは1g～2000gの活性成分/ヘクタール、より好ましくは10～1000g/ha、最も好ましくは10～600g/haである。種子灌注剤として用いられる場合、簡便な投与量は、1kgの種子に対して10mg～1gの活性物質である。

【0202】

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

【0203】

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

【0204】

本発明の組成物は、いずれかの従来形態、例えば、二液系、乾燥種子処理用粉末（DS）、種子処理用エマルジョン（ES）、種子処理用流動性濃縮物（FS）、種子処理用溶液（LS）、種子処理用水分散性粉末（WS）、種子処理用カプセル懸濁液（CF）、種子処理用ゲル（GF）、エマルジョン濃縮物（EC）、懸濁液濃縮物（SC）、サスポエマルジョン（SE）、カプセル懸濁液（CS）、水分散性顆粒（WG）、乳化性顆粒（EG）、エマルジョン、油中水型（EO）、エマルジョン、水中油型（EW）、マイクロエマルジョン（ME）、油分散体（OD）、油混和性の流動体（OF）、混油性液体（O

10

20

30

40

50

L)、可溶性濃縮物(SL)、超低体積懸濁液(SU)、超低体積液体(UL)、工業用濃縮物(TK)、分散性濃縮物(DC)、水和剤(WP)、または、農学的に許容可能な補助剤と組み合わせられるいずれかの技術的に好ましい配合物の形態で採用され得る。

【0205】

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

10

【0206】

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

20

【0207】

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

30

【0208】

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

【実施例】

【0209】

以下の実施例は本発明を例示するものである。本発明の一定の化合物は低施用量でのより高い効力により公知の化合物から区別可能であり、これは、実施例において概説されている実験手法を用い、必要に応じて、例えば50ppm、12.5ppm、6ppm、3ppm、1.5ppm、0.8ppmまたは0.2ppmといったより少ない施用量を用いることで当業者により検証可能である。

40

【0210】

本記載を通じて、温度は摂氏度で示されており、「m.p.」は融点を意味する。LC/MSは液体クロマトグラフィ質量分析を意味し、用いた装置および方法の説明は以下のとおりである。

【0211】

方法G:

スペクトルを、エレクトロスプレーソース(極性:陽イオンまたは陰イオン、キャピラリ:3.00kV、コーン範囲:30~60V、抽出器:2.00V、ソース温度:150、脱溶媒温度:350、コーンガス流:0L/Hr、脱溶媒ガス流:650L/Hr、質量範囲:100~900Da)およびWaters製Acquity UPLC:

50

バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメントおよびダイオード - アレイ検出器を備える Waters 製の質量分光計 (ACQUITY UPLC) (SQD、SQDI I または ZQ シングル四重極型質量分析計) で記録した。溶剤デガッサ、バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメントおよびダイオード - アレイ検出器。カラム: Waters UPLC HSS T3、 $1.8\ \mu\text{m}$ 、 $30 \times 2.1\text{ mm}$ 、温度: 60°C 、DAD 波長範囲 (nm): $210 \sim 500$ 、溶剤勾配: A = 水 + 5 % MeOH + 0.05 % HCOOH、B = アセトニトリル + 0.05 % HCOOH、勾配: 1.2 分間で $10 \sim 100\%$ B; 流量 (ml/min) 0.85

【0212】

方法 H:

スペクトルを、エレクトロスプレーソース (極性: 陽イオンまたは陰イオン、キャピラリ: 3.00 kV 、コーン範囲: $30 \sim 60\text{ V}$ 、抽出器: 2.00 V 、ソース温度: 150°C 、脱溶媒温度: 350°C 、コーンガス流: 0 L/Hr 、脱溶媒ガス流: 650 L/Hr 、質量範囲: $100 \sim 900\text{ Da}$) および Waters 製 Acquity UPLC: バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメントおよびダイオード - アレイ検出器を備える Waters 製の質量分光計 (ACQUITY UPLC) (SQD、SQDI I または ZQ シングル四重極型質量分析計) で記録した。溶剤デガッサ、バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメントおよびダイオード - アレイ検出器。カラム: Waters UPLC HSS T3、 $1.8\ \mu\text{m}$ 、 $30 \times 2.1\text{ mm}$ 、温度: 60°C 、DAD 波長範囲 (nm): $210 \sim 500$ 、溶剤勾配: A = 水 + 5 % MeOH + 0.05 % HCOOH、B = アセトニトリル + 0.05 % HCOOH、勾配: 2.7 分間で $10 \sim 100\%$ B; 流量 (ml/min) 0.85

【0213】

配合物実施例

【0214】

【表 2】

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

【0215】

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

【0216】

【表 3】

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

10

20

30

40

50

【 0 2 1 7 】

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

【 0 2 1 8 】

乳化性濃縮物

活性成分〔式（Ⅰ）の化合物〕	1 0 %	
オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル （ 4 ～ 5 m o l のエチレンオキシド）	3 %	
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	3 %	
ヒマシ油ポリグリコールエーテル（ 3 5 m o l のエチレンオキシド）	4 %	10
シクロヘキサノン	3 0 %	
キシレン混合物	5 0 %	

【 0 2 1 9 】

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

【 0 2 2 0 】

【表 4】

粉剤	a)	b)	c)	
活性成分〔式(I)の化合物〕	5 %	6 %	4 %	
タルカム	95 %	—	—	20
カオリン	—	94 %	—	
無機充填材	—	—	96%	

【 0 2 2 1 】

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

【 0 2 2 2 】

<u>押出し顆粒</u>		30
活性成分〔式（Ⅰ）の化合物〕	1 5 %	
リグノスルホン酸ナトリウム	2 %	
カルボキシメチルセルロース	1 %	
カオリン	8 2 %	

【 0 2 2 3 】

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

【 0 2 2 4 】

コーティングされた顆粒

活性成分〔式（Ⅰ）の化合物〕	8 %	40
ポリエチレングリコール（ m o l . w t . 2 0 0 ）	3 %	
カオリン	8 9 %	

【 0 2 2 5 】

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

【 0 2 2 6 】

懸濁液濃縮物

活性成分〔式（Ⅰ）の化合物〕	4 0 %	
プロピレングリコール	1 0 %	50

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

【 0227 】

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

10

【 0228 】

種子処理に係る流動性濃縮物

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

20

【 0229 】

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

【 0230 】

緩効性カプセル懸濁液

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

30

【 0231 】

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

【 0232 】

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

40

【 0233 】

調製例

実施例 1 : この実施例は、5 - フルオロ - 3, 3, 4, 4 - テトラメチル - 1 - (4 - メチルベンズイミダゾール - 1 - イル) イソキノリンの調製を例示する。

ステップ 1 : エチル - 2 - (2 - フルオロフェニル) - 2 - メチル - プロパノエートの調製

水素化ナトリウム (0.69 mol、27.4 g) のテトラヒドロフラン (220 mL) 中の懸濁液に、室温で、エチル - 2 - (2 - フルオロフェニル) アセテート (0.27 mol、50.0 g) およびヨードメタン (0.82 mmol、117.9 g) のテトラヒドロフラン (60 mL、濃縮、合計 1 M) の溶液を滴下し、この混合物を室温で一晩攪

50

拌した。飽和塩化アンモニウム水溶液をゆっくりと添加することにより反応を失活させ、次いで、300 mLの氷水混合物に注ぎ入れた。水性相を酢酸エチルで抽出し、組み合わせた有機抽出物を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。残渣をフラッシュクロマトグラフィ（ヘプタン/酢酸エチル = 19 : 1）により精製して、エチル - 2 - (2 - フルオロフェニル) - 2 - メチル - プロパノエートを薄い黄色の油として得た。LC - MS（方法H）UV検出：220 nm、 $R_t = 1.60$ ；MS：(M + 1) = 211.2； ^1H NMR（400 MHz，クロロホルム - d） δ ppm 1.16 - 1.23 (m, 3H) 1.57 (s, 6H) 4.17 (d, $J = 6.97$ Hz, 2H) 6.99 - 7.05 (m, 1H) 7.11 - 7.17 (m, 1H) 7.22 - 7.28 (m, 1H) 7.33 (td, $J = 7.89$, 1.83 Hz, 1H)； ^{19}F NMR（377 MHz，クロロホルム - d） δ ppm - 113.26 (s, 1 F)。

10

【0234】

ステップ2：3 - (2 - フルオロフェニル) - 2, 3 - ジメチル - ブタン - 2 - オールの調製

エチル - 2 - (2 - フルオロフェニル) - 2 - メチル - プロパノエート（0.25 mol、52.1 g）および塩化ランタン（III）ビス（塩化リチウム）錯体（THF中に0.6 M、0.50当量、0.12 mol、207 mL）のテトラヒドロフラン（1.2 M）中の溶液を室温で1.5時間撹拌した。次いで、この反応を0 に冷却し、その後、臭化メチルマグネシウムの溶液（ジエチルエーテル中に3.0 M、3.0当量、0.74 mol、248 mL）を滴下した。反応混合物を室温で一晩撹拌し、0 に冷却し、次いで、飽和塩化アンモニウム水溶液を滴下することにより失活させた。水を添加し、反応混合物をさらに30分間撹拌した。反応混合物をセライトでろ過し、2つの相を分離した。水性相をt - ブチルメチルエーテルで抽出し、組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して、3 - (2 - フルオロフェニル) - 2, 3 - ジメチル - ブタン - 2 - オールを黄色味がかった固体として得た。LC - MS（方法H）UV検出：220 nm、 $R_t = 1.46$ ；MS：(M - OH) = 179.3；m.p. 42 ~ 43； ^1H NMR（400 MHz，クロロホルム - d） δ ppm 1.19 (d, $J = 1.10$ Hz, 6H) 1.50 (d, $J = 2.93$ Hz, 6H) 6.97 - 7.04 (m, 1H) 7.07 - 7.12 (m, 1H) 7.18 - 7.24 (m, 1H) 7.40 (td, $J = 8.25$, 1.83 Hz, 1H)； ^{19}F NMR（377 MHz，クロロホルム - d） δ ppm - 104.04 (s, 1 F)。

20

30

【0235】

ステップ3：5 - フルオロ - 3, 3, 4, 4 - テトラメチル - 1 - メチルスルファニル - イソキノリンの調製。

冷却した（0）硫酸（98% w/w、133 mL、1 M）に、メチルチオシアネート（133 mmol、9.73 g）および3 - (2 - フルオロフェニル) - 2, 3 - ジメチル - ブタン - 2 - オール（1.00当量、133 mmol、26.1 g）の混合物を、数回に分け15分間かけて添加し、この混合物を室温でさらに20分間撹拌した。反応混合物を600 mLの氷水に注意深く注ぎ入れ、水層のpHをNaOH水溶液（30% w/w）を用いて約8に調節した。水性相を酢酸エチルで抽出し、組み合わせた有機相をNa₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮して、（25.1 g、75%）の5 - フルオロ - 3, 3, 4, 4 - テトラメチル - 1 - メチルスルファニル - イソキノリンを薄い黄色の油として得た。LC - MS（方法G）UV検出：220 nm、 $R_t =$ ；MS：(M + 1) =； ^1H NMR（400 MHz，クロロホルム - d） δ ppm 1.10 (s, 6H) 1.24 (d, $J = 2.93$ Hz, 6H) 2.34 (s, 3H) 7.00 (ddd, $J = 12.20$, 8.34, 1.10 Hz, 1H) 7.07 - 7.21 (m, 1H) 7.32 - 7.42 (m, 1H)； ^{19}F NMR（377 MHz，クロロホルム - d） δ ppm - 111.06 (s, 1 F)。

40

【0236】

ステップ4：5 - フルオロ - 3, 3, 4, 4 - テトラメチル - 2H - イソキノリン - 1 -

50

オンの調製。

5 - フルオロ - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - 1 - メチルスルファニル - イソキノリン (99 . 8 mmol、25 . 1 g) の、酢酸 (160 mL、0 . 25 M) および水 (40 mL) の混合物中の溶液に、酢酸ナトリウム (0 . 10 当量、9 . 98 mmol、0 . 818 g) を添加し、この混合物を還流で2時間加熱した。次いで、この反応混合物を室温に冷却し、酢酸溶液の大部分を減圧下で除去した。次いで、残渣を、飽和水性 NaHCO_3 および酢酸エチルの混合物に注意深く添加した。2つの層を分離し、水性層を酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機相を飽和水性 NaHCO_3 、水および塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮して、5 - フルオロ - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - 2 H - イソキノリン - 1 - オン (21 . 4 g、97 %) を薄い黄色の油として得た。LC - MS (方法 G) UV 検出 : 220 nm、 $R_t = 1 . 28$; MS : ($M + 1$) = 222 . 2 ; ^1H NMR (400 MHz , クロロホルム - d) δ ppm 1 . 21 (s , 6 H) 1 . 36 (d , $J = 1 . 00$ Hz , 6 H) 6 . 19 (br . s , 1 H) 7 . 12 (ddd , $J = 12 . 38$, 8 . 34 , 1 . 28 Hz , 1 H) 7 . 20 - 7 . 26 (m , 1 H) 7 . 85 (dd , $J = 7 . 52$, 1 . 28 Hz , 1 H) ; ^{19}F NMR (377 MHz , クロロホルム - d) δ ppm - 111 . 05 (s , 1 F) .

【 0237 】

ステップ5 : 1 - クロロ - 5 - フルオロ - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - イソキノリンの調製。

N , N - ジメチルホルムアミド (6 . 3 mmol、0 . 49 mL) のジクロロメタン (8 mL、0 . 8 M) 中の溶液に、室温で、塩化オキサリル (1 . 3 当量、6 . 01 mmol、0 . 53 mL) を滴下し、白色の懸濁液を30分間激しく撹拌した。次いで、5 - フルオロ - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - 2 H - イソキノリン - 1 - オン (4 . 52 mmol、1 . 00 g) のジクロロメタン (9 mL、0 . 5 M) 中の溶液を滴下し、混合物を室温で2時間撹拌した。反応混合物を飽和 NaHCO_3 水溶液とペンタンとの氷冷した混合物に注ぎ入れ、有機相を分離した。次いで、水性相をペンタンで抽出し、組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、濃縮して、1 - クロロ - 5 - フルオロ - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - イソキノリン (1 . 02 g、94 % 収率) を無色の油として得た。LC - MS (方法 G) UV 検出 : 220 nm、 $R_t = 1 . 16$; MS : ($M + 1$) = 240 ~ 242 ; ^1H NMR (400 MHz , クロロホルム - d) δ ppm 1 . 27 (s , 6 H) 1 . 38 (s , 6 H) 7 . 15 - 7 . 20 (m , 1 H) 7 . 26 - 7 . 36 (m , 1 H) 7 . 62 (d , 1 H) .

【 0238 】

ステップ6 : 5 - フルオロ - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - 1 - (4 - メチルベンズイミダゾール - 1 - イル) イソキノリンの調製。

1 - クロロ - 5 - フルオロ - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - イソキノリン (1 . 67 mmol、0 . 430 g) のピリジン (0 . 20 M、9 . 0 mL) を有する溶液に、室温で、4 - メチル - 1 H - ベンズイミダゾール (1 . 5 当量、2 . 69 mmol、0 . 356 g) を添加し、この混合物を90 で15時間撹拌した。反応混合物を室温に冷まし、次いで、減圧下で濃縮した。得られた残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、5 - フルオロ - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - 1 - (4 - メチルベンズイミダゾール - 1 - イル) イソキノリン (0 . 525 g、87 % 収率) をベージュ色の固体として得た。mp = 118 ~ 120 、LC - MS (方法 G) UV 検出 : 220 nm、 $R_t = 1 . 19$ 、MS : ($M + 1$) = 336 ; ^1H NMR (400 MHz , クロロホルム - d) δ ppm 1 . 32 (s , 6 H) 1 . 47 (s , 6 H) 2 . 71 (s , 3 H) 6 . 91 - 6 . 95 (m , 1 H) 7 . 10 - 7 . 25 (m , 5 H) 8 . 18 (s , 1 H) .

【 0239 】

実施例2 : この実施例は、4 , 4 - ジフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 1 - (4 - メチルベンズイミダゾール - 1 - イル) イソキノリンの調製を例示する

ステップ1 : 3 , 3 - ジメチル - 2 H - イソキノリン - 1 , 4 - ジオンの調製。

3, 3 - ジメチル - 2, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - オン (57.1 mmol、10.0 g) の CCl_4 (0.20 M、285 mL) 中の溶液に、室温で、N - プロモスクシンイミド (3.0 当量、171 mmol、30.5 g) および AIBN (0.15 当量、8.5 mmol、1.43 g) を添加し、この反応混合物を 70 で 3 時間攪拌した。反応混合物を室温に冷まし、減圧下で濃縮し、EtOAc で希釈し、水および塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、濃縮して、4, 4 - ジブromo - 3, 3 - ジメチル - 2 H - イソキノリン - 1 - オン (25.2 g) を明るい黄色の固体として得、これをさらに精製することなく次のステップにおいて直接用いた。LC - MS (方法 H) UV 検出: 220 nm、 $R_t = 1.34$; MS: $(M + 1) = 332 \sim 334 - 336$; ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) δ ppm 1.57 (s, 6H) 7.21 (br. s, 1H) 7.70 - 7.77 (m, 1H) 7.78 - 7.85 (m, 1H) 8.06 - 8.14 (m, 1H) 8.23 - 8.30 (m, 1H).

10

【0240】

4, 4 - ジブromo - 3, 3 - ジメチル - 2 H - イソキノリン - 1 - オン (20.0 g) の水 (450 mL) およびテトラヒドロフラン (225 mL) の混合物中の溶液に、炭酸ナトリウム (3.0 当量、135 mmol、14.3 g) を添加し、この混合物を室温で 12 時間、および、70 で 4 時間 30 分攪拌した。反応混合物を室温に冷まし、水で希釈し、90 mL の 2 M 塩酸溶液で pH 3 ~ 4 に酸性化し、ジクロロメタンで抽出した。組み合わせた有機抽出物を Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、濃縮して、3, 3 - ジメチル - 2 H - イソキノリン - 1, 4 - ジオン (9.95 g) を黄色の固体として得た。LC - MS (方法 H) UV 検出: 220 nm、 $R_t = 0.81$; MS: $(M + 1) = 190$; ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) δ ppm 1.77 (s, 3H) 1.97 (s, 3H) 7.39 (s, 1H) 7.46 - 7.58 (m, 1H) 7.60 - 7.71 (m, 1H) 7.98 - 8.22 (m, 2H).

20

【0241】

ステップ 2: 1 - クロロ - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オンの調製。

N, N - ジメチルホルムアミド (2.3 mL、30 mmol) のジクロロメタン (52 mL、0.6 M) 中の溶液に、室温で、塩化オキサリル (0.67 当量、20 mmol、1.8 mL) を 35 分間の時間をかけて滴下し、この白色の懸濁液を 15 分間、ガスの発生が停止するまで激しく攪拌した。次いで、3, 3 - ジメチル - 2 H - イソキノリン - 1, 4 - ジオン (2.5 g、13 mmol) のジクロロメタン (25 mL) 中の溶液を滴下し、この混合物を室温で 1 時間攪拌した。反応混合物を飽和 NaHCO_3 水溶液とペンタンとの氷冷した混合物に注ぎ入れ、有機相を分離した。次いで、水性相をペンタンで抽出し、組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、濃縮して、1 - クロロ - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オン (2.5 g、91% 収率) を黄色の固体として得た。LC - MS (方法 H) UV 検出: 220 nm、 $R_t = 1.34$; MS: $(M + 1) = 208 \sim 210$; ^1H NMR (400 MHz, クロロホルム - d) δ ppm 1.47 (s, 6H) 7.62 - 7.69 (m, 1H) 7.73 - 7.81 (m, 1H) 7.90 (dd, $J = 8.07, 0.73$ Hz, 1H) 8.04 (dd, $J = 7.50, 0.90$ Hz, 1H).

30

40

【0242】

ステップ 3: 3, 3 - ジメチル - 1 - (4 - メチルベンズイミダゾール - 1 - イル) イソキノリン - 4 - オンの調製。

1 - クロロ - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オン (3.61 mmol、0.750 g) のピリジン (0.07 M、50 mL) 中の溶液に、室温で、4 - メチル - 1 H - ベンズイミダゾール (1.5 当量、0.716 g、5.42 mmol) を添加し、この混合物を 100 で 15 時間攪拌した。反応混合物を室温に冷まし、次いで、減圧下で濃縮した。得られた残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、3, 3 - ジメチル - 1 - (4 - メチルベンズイミダゾール - 1 - イル) イソキノリン - 4 - オン (0.569 g、52% 収率) を茶色の油として得た。LC - MS (方法 G) UV 検出: 220 nm、

50

$R_t = 0.98$ 、 $MS: (M+1) = 305$; 1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ ppm 1.63 (s, 6H) 2.75 (s, 3H) 7.15 - 7.27 (m, 3H) 7.36 - 7.42 (m, 1H) 7.70 - 7.82 (m, 2H) 8.18 - 8.25 (m, 1H) 8.28 (s, 1H).

【0243】

ステップ4: 4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 1 - (4 - メチルベンズイミダゾール - 1 - イル) イソキノリンの調製。

3, 3 - ジメチル - 1 - (4 - メチルベンズイミダゾール - 1 - イル) イソキノリン - 4 - オン (1.85 mmol、560 mg) の2, 2 - ジフルオロ - 1, 3 - ジメチル - イミダゾリジン (10.0 当量、18.5 mmol、2.4 mL) 中の溶液を105 で一晩攪拌した。反応混合物を室温に冷まし、DCMで希釈し、次いで、飽和 $NaHCO_3$ 水溶液をゆっくりと添加することにより失活させた。2つの相を分離し、水性相をDCMで抽出した。組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 1 - (4 - メチルベンズイミダゾール - 1 - イル) イソキノリン (36 mg、60% 収率) を白色の固体として得た。LC-MS (方法G) UV検出: 220 nm、 $R_t = 1.12$; $MS: (M+1) = 326$; mp 142 ~ 149 ; 1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ ppm 1.49 (s, 6H) 2.76 (s, 3H) 7.15 - 7.27 (m, 2H) 7.34 - 7.42 (m, 2H) 7.57 - 7.64 (m, 1H) 7.71 - 7.79 (m, 1H) 7.90 - 7.97 (m, 1H) 8.31 (s, 1H); ^{19}F NMR (377 MHz, クロロホルム-d) δ ppm -112.38 (br. s., 1 F).

【0244】

実施例3: この実施例は、1' - (ベンズイミダゾール - 1 - イル) - 3', 3' - ジメチル - スピロ (シクロプロパン - 1, 4' - イソキノリン) の調製を例示する

ステップ1: 3, 3 - ジメチルスピロ (2H - イソキノリン - 4, 1' - シクロプロパン) - 1 - オンの調製。

オートクレーブ中に、2 - (1 - フェニルシクロプロピル) プロパン - 2 - アミン (120 mg、0.685 mmol)、ベンゾキノン (2.0 当量、1.37 mmol、153 mg) および酢酸パラジウム (II) (0.05 当量、0.034 mmol、7.6 mg) の酢酸 (4.6 mL、0.15 M) 中の溶液を入れ、高圧反応器を一酸化炭素 (3 bar) で加圧し、110 で一晩加熱した。反応容器を室温に冷まし、減圧し、反応混合物をジクロロメタンで希釈し、 $NaOH$ 水溶液 (2.0 M) を添加して $pH > 9$ とすることにより失活させた。2つの相を分離し、水性相をジクロロメタンで2回抽出した。組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、濃縮し、フラッシュクロマトグラフィにより精製して、3, 3 - ジメチルスピロ (2H - イソキノリン - 4, 1' - シクロプロパン) - 1 - オン (27 mg、20% 収率) を黄色味がかったガムとして得た。LC-MS (方法G)、 $R_t = 0.80$; $MS: (M+1) = 202$; 1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ ppm 0.96 (t, 2H) 1.10 (t, 2H) 1.18 (s, 6H) 6.21 (NH, 1H) 6.91 (d, 1H) 7.20 (t, 1H) 7.45 (t, 1H) 8.09 (d, 1H).

【0245】

ステップ2: 1' - クロロ - 3', 3' - ジメチル - スピロ (シクロプロパン - 1, 4' - イソキノリン) の調製。

N, N - ジメチルホルムアミド (0.63 mmol、0.049 mL) のジクロロメタン (1 mL、0.5 M) 中の溶液に、室温で、塩化オキサリル (1.3 当量、0.63 mmol、0.056 mL) を滴下し、この白色の懸濁液を30分間激しく攪拌した。次いで、3, 3 - ジメチルスピロ (2H - イソキノリン - 4, 1' - シクロプロパン) - 1 - オン (0.423 mmol、85 mg) のジクロロメタン (0.8 mL、濃縮、合計0.25 M) 中の溶液を滴下し、この混合物を室温で1時間攪拌した。反応混合物を飽和 Na

HCO₃水溶液とペンタンとの氷冷した混合物に注ぎ入れ、有機相を分離した。次いで、水性相をペンタンで抽出し、組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、濃縮して、1'-クロロ-3',3'-ジメチル-スピロ(シクロプロパン-1,4'-イソキノリン)(101mg、98%収率)をベージュ色の液体として得た。LC-MS(方法G)、Rt = 1.06; MS: (M + 1) = 220 ~ 222。

【0246】

ステップ3: 1'-(ベンズイミダゾール-1-イル)-3',3'-ジメチル-スピロ(シクロプロパン-1,4'-イソキノリン)の調製。

1'-クロロ-3',3'-ジメチル-スピロ(シクロプロパン-1,4'-イソキノリン)(0.064mmol、14mg)のピリジン(1.3mL、0.05M)中の溶液に、ベンズイミダゾール(5当量、0.32mmol、38mg)を添加し、この混合物を90℃で1時間撹拌した。反応混合物を室温に冷まし、次いで、減圧下で濃縮した。得られた残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、1'-(ベンズイミダゾール-1-イル)-3',3'-ジメチル-スピロ(シクロプロパン-1,4'-イソキノリン)(9mg、50%収率)を黄色のガムとして得た。LC-MS(方法G)、Rt = 1.04; MS: (M + 1) = 302; ¹H NMR(400MHz, クロロホルム-d) δ ppm 1.01(t, 2H) 1.17(t, 2H) 1.23(s, 6H) 7.08(d, 1H) 7.15-7.24(m, 2H) 7.27-7.35(m, 2H) 7.48(t, 1H) 7.52(d, 1H) 7.84(d, 1H) 8.30(s, 1H)。

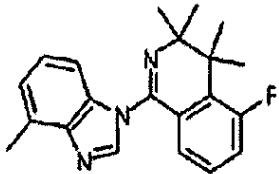
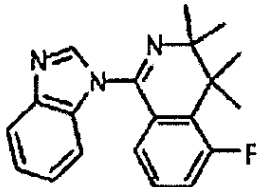
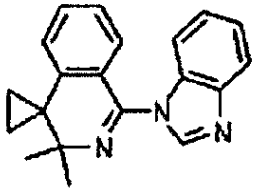
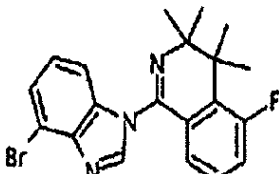
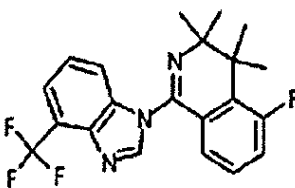
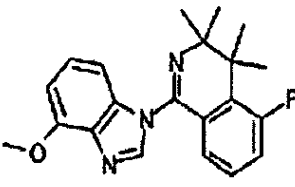
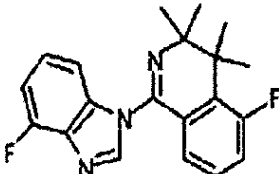
【0247】

表E: 式Iの化合物の物理的データ

10

20

【表 5 - 1】

項目	構造	RT (min)	[M+H] (計測値)	方法	MP °C
E-1		1.15	336.4	G	45 - 46
E-2		1.13	322.5	G	
E-3		1.04	302	G	
E-4		1.22	401.3	G	48 - 49
E-5		1.25	390.5	G	
E-6		1.13	352.5	G	
E-7		1.17	340.4	G	

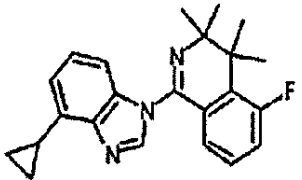
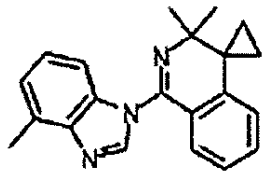
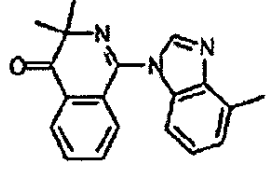
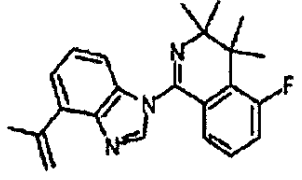
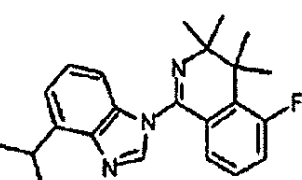
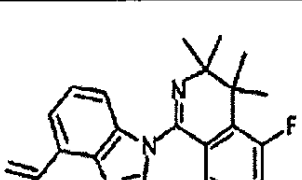
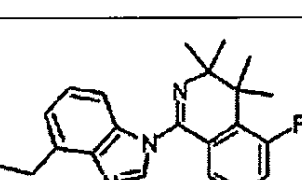
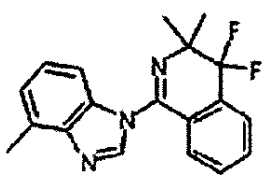
10

20

30

40

【表 5 - 2】

E-8		1.26	362.5	G	
E-9		1.10	316	G	
E-10		0.96	304	G	123 - 125
E-11		1.30	362.5	G	
E-12		1.31	364.5	G	113 - 114
E-13		1.25	348.4	G	70 - 71
E-14		1.25	350.5	G	87 - 88
E-15		1.10	326	G	

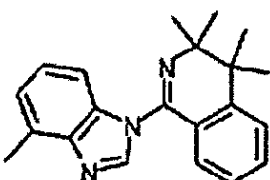
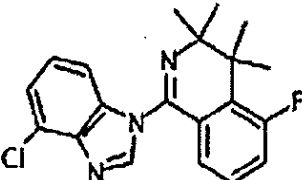
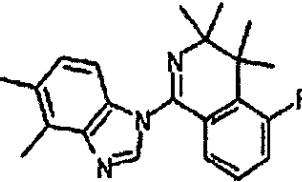
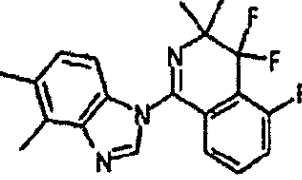
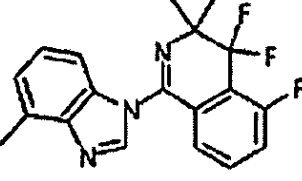
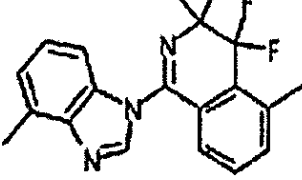
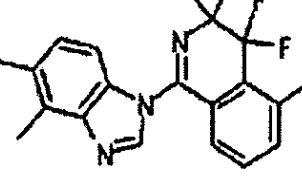
10

20

30

40

【表 5 - 3】

E-16		1.14	318	G	
E-17		1.21	356.4	G	50 - 51
E-18		1.19	350.6	G	
E-19		1.13	358	G	157 - 159
E-20		1.08	344	G	
E-21		1.14	340.5	G	
E-22		1.18	354.5	G	

10

20

30

40

【表 5 - 4】

E-23		1.13	340.5	G	132-133
E-24		1.10	380.4	G	178 - 179
E-25		0.99	318.4	G	159 - 161
E-26		1.03	318.5	G	96 - 101
E-27		1.07	332.5	G	145 - 149
E-28		1.81	347	H	199-202
E-29		1.51	325	H	

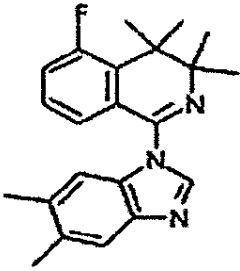
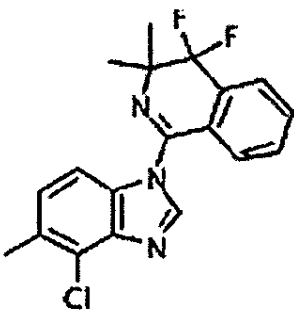
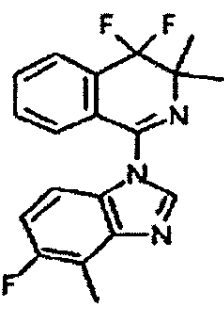
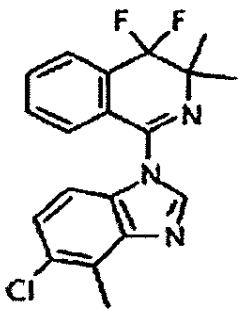
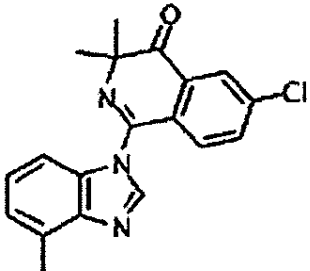
10

20

30

40

【表 5 - 5】

E-30		1.21	351	G	
E-31		1.92	362	H	
E-32		1.16	344	G	118 - 121
E-33		1.23	361	G	
E-34		1.71	339	H	129 - 133

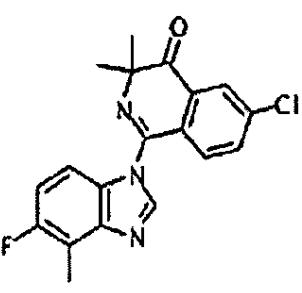
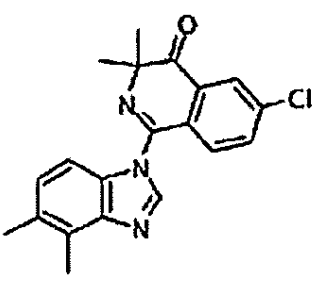
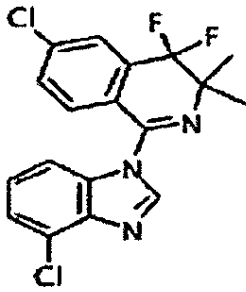
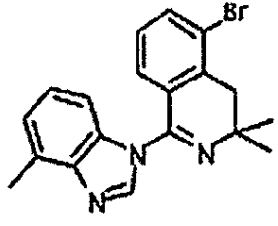
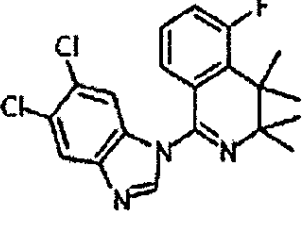
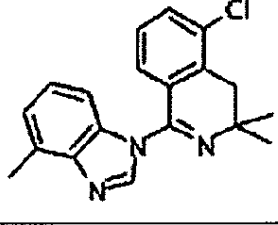
10

20

30

40

【表 5 - 6】

E-35		1.80	357	H	133 - 136
E-36		1.83	353	H	196 - 199
E-37		2.00	381	H	197 - 200
E-38		1.19	369	G	52 - 54
E-39		1.32	391	G	126 - 127
E-40		1.17	324	G	

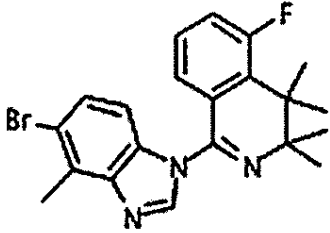
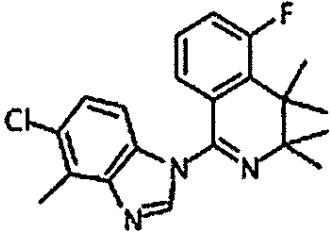
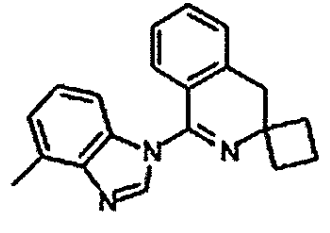
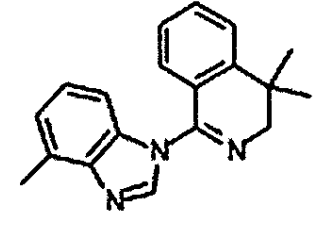
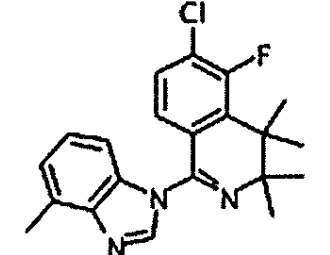
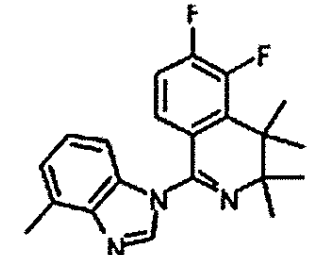
10

20

30

40

【表 5 - 7】

E-41		1.33	415	G	122 - 124
E-42		1.31	370	G	102 - 103
E-43		1.12	302	G	132 - 133
E-44		1.07	290	G	
E-45		1.27	370	G	147 - 151
E-46		1.21	354	G	122 - 125

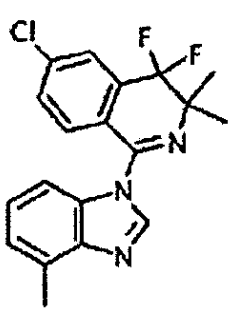
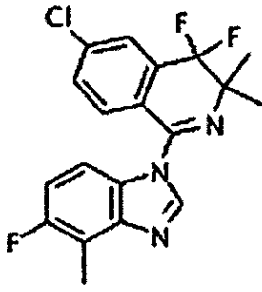
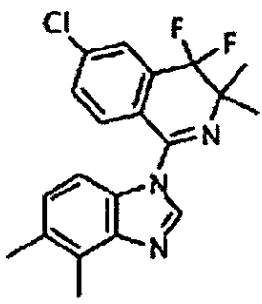
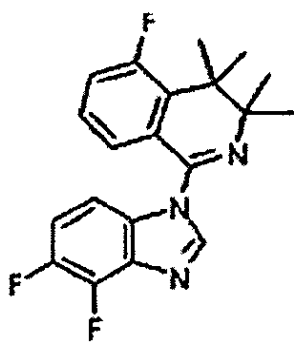
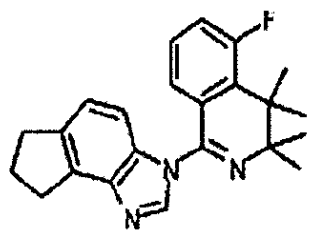
10

20

30

40

【表 5 - 8】

E-47		1.99	361	H	
E-48		2.06	379	H	
E-49		2.10	375	H	
E-50		1.23	358	G	112 - 114
E-51		1.27	362	G	177 - 178

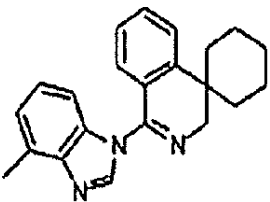
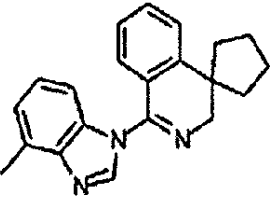
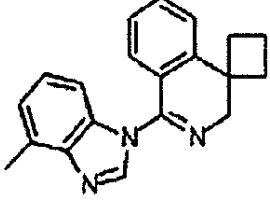
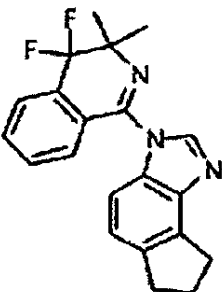
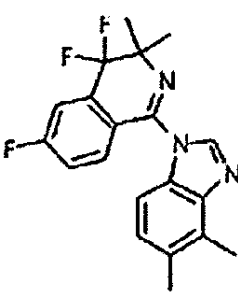
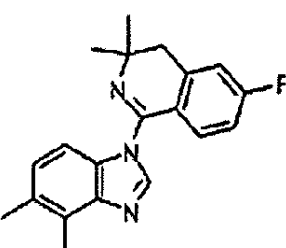
10

20

30

40

【表 5 - 9】

E-52		1.27	330	G	
E-53		1.20	316	G	
E-54		0.81	302	G	
E-55		1.88	352	H	
E-56		1.92	358	H	
E-57		1.75	322	H	143 - 145

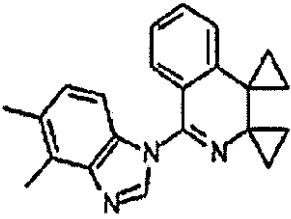
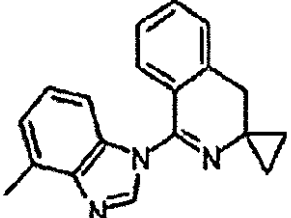
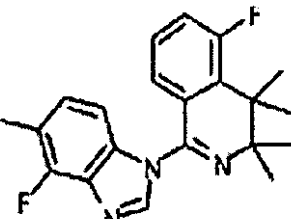
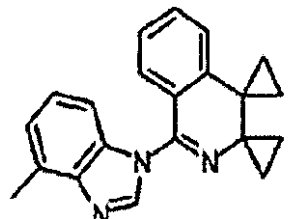
10

20

30

40

【表 5 - 1 0】

E-58		1.14	328	G	141 - 143
E-59		1.06	288	G	
E-60		1.24	354	G	
E-61		1.11	314	G	

10

20

30

【 0 2 4 8】

生物学の実施例

ボトリオチニアフッケリアナ (*Botryotinia fuckeliana*) (ボトリチス シネレア (*Botrytis cinerea*)) / 液体培養 (灰色カビ病)

極低温保管しておいた菌類の分生子を栄養液体培地 (Vogel's 液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 3 ~ 4 日間後に、成長の阻害を測光法により測定する。

40

【 0 2 4 9】

表 E の以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照葉片と比した場合に、200 ppm で少なくとも 80 % 病害防除をもたらした: E - 1、E - 2、E - 3、E - 4、E - 5、E - 6、E - 7、E - 8、E - 9、E - 10、E - 11、E - 12、E - 13、E - 14、E - 15、E - 16、E - 17、E - 18、E - 19、E - 20、E - 21、E - 22、E - 23、E - 25、E - 26、E - 27、E - 29、E - 30、E - 31、E - 32、E - 33、E - 34、E - 35、E - 36、E - 37、E - 38、E - 39、E - 40、E - 41、E - 42、E - 43、E - 44、E

50

- 45、E - 46、E - 47、E - 48、E - 49、E - 50、E - 51、E - 52、E - 53、E - 54、E - 55、E - 56、E - 57、E - 58、E - 59、E - 60、E - 61。

【0250】

フザリウムクルモルム (*Fusarium culmorum*) / 液体培養 (胴枯れ病)

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

10

【0251】

表 E の以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照葉片と比した場合に、200 ppm で少なくとも 80 % 病害防除をもたらした：E - 1、E - 2、E - 4、E - 7、E - 9、E - 14、E - 15、E - 16、E - 17、E - 18、E - 19、E - 20、E - 21、E - 22、E - 23、E - 25、E - 26、E - 27、E - 30、E - 31、E - 32、E - 33、E - 34、E - 35、E - 36、E - 41、E - 42、E - 45、E - 46、E - 47、E - 48、E - 49、E - 50、E - 51、E - 55、E - 56、E - 57、E - 58、E - 59、E - 60、E - 61。

【0252】

ゲーウマノミセスグラミニス (*Gaeumannomyces graminis*) / 液体培養 (穀類の立枯病)

20

極低温保管しておいた菌類の菌糸体断片を、栄養液体培地 (PDB ジャガイモブドウ糖液体培地) に直接混合した。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 4 ~ 5 日間後に、成長の阻害を測光法により測定する。

【0253】

表 E の以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照葉片と比した場合に、200 ppm で少なくとも 80 % 病害防除をもたらした：E - 1、E - 3、E - 4、E - 7、E - 8、E - 9、E - 14、E - 15、E - 16、E - 17、E - 18、E - 19、E - 21、E - 23、E - 30、E - 31、E - 32、E - 33、E - 37、E - 41、E - 47、E - 48、E - 49、E - 51、E - 58、E - 59、E - 60、E - 61。

30

【0254】

グロメララゲナリウム (*Glomerella lagenarium*) (コレトリカムラゲナリウム (*Colletotrichum lagenarium*)) / 液体培養 (炭疽病)

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

40

【0255】

表 E の以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照葉片と比した場合に、200 ppm で少なくとも 80 % 病害防除をもたらした：E - 1、E - 2、E - 3、E - 4、E - 5、E - 6、E - 7、E - 8、E - 9、E - 10、E - 11、E - 12、E - 13、E - 14、E - 15、E - 16、E - 17、E - 18、E - 19、E - 20、E - 21、E - 22、E - 23、E - 25、E - 26、E - 27、E - 30、E - 31、E - 32、E - 33、E - 38、E - 39、E - 40、E - 41、E - 42、E - 43、E - 44、E - 45、E - 46、E - 49、E - 50、E - 54、E

50

- 55、E - 56、E - 57、E - 58、E - 59、E - 60、E - 61。

【0256】

モノグラフェラニバリス (*Monographella nivalis*) (コムギ赤かび病菌 (*Microdochium nivale*)) / 液体培養 (穀類の根腐れ病)

極低温保管しておいた菌類の分生子を栄養液体培地 (PDB ジャガイモブドウ糖液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 4 ~ 5 日間後に、成長の障害を測光法により測定する。

【0257】

表 E の以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照葉片と比した場合に、200 ppm で少なくとも 80 % 病害防除をもたらした：E - 1、E - 2、E - 4、E - 5、E - 6、E - 7、E - 8、E - 9、E - 10、E - 11、E - 12、E - 13、E - 14、E - 15、E - 16、E - 17、E - 18、E - 19、E - 20、E - 21、E - 22、E - 23、E - 25、E - 26、E - 27、E - 30、E - 31、E - 32、E - 33、E - 34、E - 37、E - 38、E - 39、E - 40、E - 41、E - 42、E - 43、E - 44、E - 45、E - 46、E - 47、E - 48、E - 49、E - 50、E - 51、E - 53、E - 54、E - 55、E - 56、E - 57、E - 58、E - 59、E - 60、E - 61。

【0258】

コムギ葉枯病菌 (*Mycosphaerella graminicola*) (セプトリア トリティシ (*Septoria tritici*)) / 液体培養 (葉枯病)

極低温保管しておいた菌類の分生子を栄養液体培地 (PDB ジャガイモブドウ糖液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 4 ~ 5 日間後に、成長の障害を測光法により測定する。

【0259】

表 E の以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照葉片と比した場合に、200 ppm で少なくとも 80 % 病害防除をもたらした：E - 1、E - 18、E - 21、E - 22、E - 30、E - 32、E - 33、E - 34、E - 35、E - 36、E - 50、E - 53、E - 54、E - 55、E - 56、E - 57、E - 60。

【0260】

マグナポルテグリスア (*Magnaporthe grisea*) (イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*)) / イネ / 葉片予防 (稲熱病)

イネの葉切片 (cv. Ballila) をマルチウェルプレート (24 ウェル型) 中の寒天の上に載せ、水で希釈した配合したテスト化合物を噴霧する。適用から 2 日後に、葉切片菌の孢子懸濁液で播種する。気候キャビネット中において、24 時間の暗闇、これに続く、12 時間の光 / 12 時間の暗闇の光環境下、22 および 80 % の相対湿度で播種した葉切片をインキュベートし、化合物の活性を、適切なレベルの病害による損傷が未処理の検査用の葉切片に現れた時点で (適用から 5 ~ 7 日間)、未処理のものと比した病害防除割合として評価する。

【0261】

表 E の以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照葉片と比した場合に、200 ppm で少なくとも 80 % 病害防除をもたらした：E - 21、E - 42、E - 49、E - 50。

【0262】

マグナポルテグリスア (*Magnaporthe grisea*) (イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*)) / 液体培養 (稲熱病)

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

【0263】

以下の化合物が、大幅な病害の発生を示した未処理の対照と同一の条件下において比した場合に、20ppmで、マグナポルテグリセア（Magnaporthe grisea）の少なくとも80%の防除をもたらした：E-1、E-4、E-5、E-6、E-7、E-8、E-9、E-10、E-11、E-12、E-13、E-14、E-15、E-16、E-17、E-18、E-19、E-20、E-21、E-22、E-23、E-24、E-25、E-26、E-27、E-30、E-31、E-32、E-33、E-34、E-35、E-36、E-37、E-38、E-39、E-40、E-41、E-42、E-43、E-44、E-45、E-46、E-47、E-48、E-49、E-50、E-51、E-52、E-53、E-54、E-55、E-56、E-57、E-58、E-59、E-60、E-61。

10

【0264】

フザリウムクルモルム（Fusarium culmorum）/コムギ/小穂予防（胴枯れ病）

コムギ小穂（cv. Monsun）をマルチウェルプレート（24ウェル型）中の寒天の上に載せ、水で希釈した配合したテスト化合物を噴霧する。適用から1日後に、小穂を菌の孢子懸濁液で播種する。気候室中において、72時間の半暗闇、これに続く、12時間の光/12時間の暗闇の光環境下、20および60%の相対湿度で播種した小穂をインキュベートし、化合物の活性を、適切なレベルの病害による損傷が未処理の検査用小穂に現れた時点で（適用から6～8日間）、未処理のものと比した病害防除割合として評価する。

20

【0265】

以下の化合物が、大幅な病害の発生を示した未処理の対照と同一の条件下で比した場合に、200ppmで、フザリウムクルモルム（Fusarium culmorum）の少なくとも80%の防除をもたらした：E-20、E-46、E-49、E-56、E-58。

30

【0266】

ピレノホラテレス（Pyrenophora teres）/オオムギ/葉片予防（網斑病）

オオムギ葉切片（cv. Hasso）をマルチウェルプレート（24ウェル型）中の寒天の上に載せ、水で希釈した配合したテスト化合物を噴霧する。適用から2日後に、葉切片を菌の孢子懸濁液で播種する。気候キャビネット中において、12時間の光/12時間の暗闇の光環境下、20および65%の相対湿度で播種した葉切片をインキュベートし、化合物の活性を、適切なレベルの病害による損傷が未処理の検査用の葉切片に現れた時点で（適用から5～7日間）、未処理のものと比した病害防除として評価する。

40

【0267】

以下の化合物が、大幅な病害の発生を示した未処理の対照と同一の条件下で比した場合に、200ppmで、ピレノホラテレス（Pyrenophora teres）の少なくとも80%の防除をもたらした：E-16。

【0268】

ピレノホラテレス（Pyrenophora teres）/液体培養（網斑病）

極低温保管しておいた菌類の分生子を栄養液体培地（Vogel's液体培地）に直接混合する。テスト化合物の（DMSO）溶液をマイクロタイタープレート（96ウェル型）に入れた後、菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを24でインキュベートし、適用から3～4日間後に、成長の阻害を測光法により測定する。

50

【0269】

以下の化合物が、大幅な病害の発生を示した未処理の対照と同一の条件下で比した場合に、20ppmで、ピレノホラテレス (*Pyrenophora teres*) の少なくとも80%の防除をもたらした：E-1、E-4、E-5、E-6、E-7、E-9、E-10、E-11、E-12、E-13、E-14、E-15、E-16、E-17、E-18、E-19、E-20、E-21、E-22、E-23、E-25、E-26、E-27。

【0270】

スクレロティニア スクレロティオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*) / 液体培養 (菌核病 (*cottony rot*))

10

新たに増殖させた液体培養の菌類の菌糸体断片を、栄養液体培地 (*Vogel's* 液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (*DMSO*) 溶液をマイクロタイタープレート (96ウェル型) に入れた後、菌性の物質を含有する栄養液体培地を添加する。テストプレートを24でインキュベートし、適用から3~4日間後に、成長の阻害を測光法により測定する。

【0271】

以下の化合物が、大幅な病害の発生を示した未処理の対照と同一の条件下で比した場合に、20ppmで、スクレロティニア スクレロティオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*) の少なくとも80%の防除をもたらした：E-1、E-15、E-16、E-17、E-18、E-19、E-20、E-21、E-22、E-23、E-25、E-26、E-27、E-30、E-31、E-32、E-33、E-37、E-38、E-39、E-40、E-41、E-42、E-43、E-44、E-45、E-46、E-55、E-56、E-57、E-58、E-61。

20

フロントページの続き

- (74)代理人 100119013
弁理士 山崎 一夫
- (74)代理人 100123777
弁理士 市川 さつき
- (74)代理人 100111796
弁理士 服部 博信
- (74)代理人 100162422
弁理士 志村 将
- (72)発明者 ボウ ハムダン ファルハン
スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション ミュンヒヴィーレン アーゲー内
- (72)発明者 クアランタ ラウラ
スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション ミュンヒヴィーレン アーゲー内
- (72)発明者 トラー ステファン
スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション ミュンヒヴィーレン アーゲー内
- (72)発明者 ヴァイス マティアス
スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション ミュンヒヴィーレン アーゲー内

審査官 早乙女 智美

- (56)参考文献 米国特許出願公開第2 0 1 2 / 0 2 8 2 3 4 9 (U S , A 1)
特開2 0 1 3 - 1 7 3 7 7 4 (J P , A)
特開2 0 0 7 - 2 1 7 3 5 3 (J P , A)
国際公開第2 0 0 9 / 0 8 1 5 7 9 (W O , A 1)
特表2 0 0 9 - 5 4 4 5 8 9 (J P , A)
XIAO, Q. et al., Generation of diverse 1-imidazolylisoquinolines via silver triflate-catalyzed reaction of 2-alkynylbenzaldehyde with imidazole, Molecular Diversity, 2 0 1 2 年, 16(2), pp. 261-268

- (58)調査した分野(Int.Cl., D B 名)
C 0 7 D
A 0 1 N
C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N)