

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第5870094号
(P5870094)

(45) 発行日 平成28年2月24日 (2016. 2. 24)

(24) 登録日 平成28年1月15日 (2016. 1. 15)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 277/24 (2006. 01)

C O 7 D 277/24 C S P

C O 7 D 277/32 (2006. 01)

C O 7 D 277/32

A O 1 N 43/78 (2006. 01)

A O 1 N 43/78 A

A O 1 P 21/00 (2006. 01)

A O 1 P 21/00

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

A O 1 P 3/00

請求項の数 10 (全 47 頁)

(21) 出願番号 特願2013-511647 (P2013-511647)
 (86) (22) 出願日 平成23年5月24日 (2011. 5. 24)
 (65) 公表番号 特表2013-531632 (P2013-531632A)
 (43) 公表日 平成25年8月8日 (2013. 8. 8)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2011/058440
 (87) 国際公開番号 W02011/147815
 (87) 国際公開日 平成23年12月1日 (2011. 12. 1)
 審査請求日 平成26年5月9日 (2014. 5. 9)
 (31) 優先権主張番号 61/350, 514
 (32) 優先日 平成22年6月2日 (2010. 6. 2)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)
 (31) 優先権主張番号 10164141. 3
 (32) 優先日 平成22年5月27日 (2010. 5. 27)
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)

(73) 特許権者 512137348
 バイエル・インテレクチュアル・プロパティ・ゲゼルシャフト・ミット・ベシュレンクテル・ハフツング
 Bayer Intellectual Property GmbH
 ドイツ40789モンハイム・アム・ライン、アルフレート・ノーベル・シュトラッセ10番
 (74) 代理人 100146318
 弁理士 岩瀬 吉和
 (74) 代理人 100114188
 弁理士 小野 誠
 (74) 代理人 100119253
 弁理士 金山 賢教

最終頁に続く

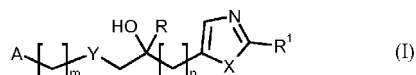
(54) 【発明の名称】 殺菌剤としての複素環アルカノール誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式 (I) の複素環アルカノール誘導体および該化合物の農芸化学的に活性な塩。

【化 1】



〔式中、

XはSであり、

YはO、-CH₂-または直接結合であり、

mは0または1であり、

nは0または1であり、

Rは、各場合で、分岐していても良いC₃-C₇-アルキル、C₁-C₈-ハロアルキル、C₂-C₇-アルケニル、C₂-C₇-ハロアルケニル；ハロゲン-、C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-ハロアルキル-、C₁-C₄-アルコキシ-、C₁-C₄-ハロアルコキシ-、C₁-C₄-ハロアルキルチオ-またはC₁-C₄-アルキルチオ-置換されていても良いC₃-C₇-シクロアルキル；およびモノからトリ-ハロゲン-または-C₁-C₄-アルキル-置換されていても良いフェニルであり、

R¹は、水素またはハロゲンであり、

Aは、各場合でジ-Z-置換されたフェニルであり、前記2個の置換基Zは同一であるか異なっており、

Zは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、OH、SH、C(C₁-C₅-アルキル) (=NO(C₁-C₅-アルキル))、C₃-C₇-シクロアルキル、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₁-C₄-アルキルチオ、C₁-C₄-ハロアルキルチオ、C₂-C₄-アルケニル、C₂-C₄-ハロアルケニル、C₂-C₄-アルキニル、C₂-C₄-ハロアルキニル、C₁-C₄-アルキルスルフィニル、C₁-C₄-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₄-アルキルスルホニル、C₁-C₄-ハロアルキルスルホニル、ホルミル、C₂-C₅-アルキルカルボニル、C₂-C₅-ハロアルキルカルボニル、C₂-C₅-アルコキシカルボニル、C₂-C₅-ハロアルコキシカルボニル、C₃-C₆-アルケニルオキシ、C₃-C₆-アルキニルオキシ、C₂-C₅-アルキルカルボニルオキシ、C₂-C₅-ハロアルキルカルボニルオキシ、トリアルキルシリル、または各場合でハロゲン-、C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-ハロアルキル-、C₁-C₄-アルコキシ-またはC₂-C₄-アルキルカルボニルでモノ置換されていても良いフェニル、フェノキシまたはフェニルチオである。]

10

【請求項2】

XがSであり、

YがO、-CH₂-または直接結合であり、

mが0または1であり、

20

nが0または1であり、

Rが各場合で、分岐していても良いC₃-C₅-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₅-アルケニル、C₃-C₅-ハロアルケニル；ハロゲン-、C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-ハロアルキル-、C₁-C₄-アルコキシ-、C₁-C₄-ハロアルコキシ-、C₁-C₄-ハロアルキルチオ-またはC₁-C₄-アルキルチオ-置換されていても良いC₃-C₆-シクロアルキルであり、

R¹が水素またはハロゲンであり、

Aが各場合で、ジ-Z-置換されたフェニルであり、前記2個の置換基Zは同一であるか異なっており、

Zがハロゲン、シアノ、ニトロ、C(C₁-C₅-アルキル) (=NO(C₁-C₅-アルキル))、C₃-C₆-シクロアルキル、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₁-C₄-アルキルチオ、C₁-C₄-ハロアルキルチオ、C₂-C₄-アルケニル、C₂-C₄-アルキニル、C₁-C₄-アルキルスルフィニル、C₁-C₄-アルキルスルホニル、C₂-C₅-アルキルカルボニル、C₂-C₅-アルコキシカルボニル、C₃-C₆-アルケニルオキシ、C₃-C₆-アルキニルオキシ、C₂-C₅-アルキルカルボニルオキシ、または各場合でハロゲン-、C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-ハロアルキル-、C₁-C₄-アルコキシ-またはC₂-C₄-アルキルカルボニル-モノ置換されていても良いフェニル、フェノキシまたはフェニルチオである請求項1に記載の式(I)の複素環アルカノール誘導体。

30

40

【請求項3】

植物病原性有害真菌の防除方法において、請求項1または2に記載の式(I)の複素環アルカノール誘導体を当該植物病原性有害真菌および／またはその生息場所に施用することを特徴とする方法。

【請求項4】

植物病原性有害真菌を防除するための組成物において、増量剤および／または界面活性剤に加えて、少なくとも1種類の請求項1または2に記載の式(I)の複素環アルカノール誘導体を含むことを特徴とする組成物。

【請求項5】

殺虫剤、誘引剤、滅菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、成長調節剤、除草

50

剤、肥料、薬害軽減剤および情報物質の群から選択される少なくとも1種類の別の有効成分を含む請求項4に記載の組成物。

【請求項6】

植物病原性有害真菌の防除における請求項1または2に記載の式(I)の複素環アルカノール誘導体の使用。

【請求項7】

植物成長調節剤としての請求項1または2に記載の式(I)の複素環アルカノール誘導体の使用。

【請求項8】

植物病原性有害真菌を防除するための組成物の製造方法において、請求項1または2に記載の式(I)の複素環アルカノール誘導体を増量剤および／または界面活性剤と混和させることを特徴とする方法。

10

【請求項9】

トランスジェニック植物の処理における請求項1に記載の式(I)の複素環アルカノール誘導体の使用。

【請求項10】

種子およびトランスジェニック植物の種子の処理における請求項1に記載の式(I)の複素環アルカノール誘導体の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

20

【0001】

本発明は、新規な複素環アルカノール誘導体、これら化合物の製造方法、これら化合物を含む組成物、ならびに、特に作物保護および材料保護において有害微生物を防除するための生理活性化合物としての、そして植物成長調節剤としてのその使用に関するものである。

【背景技術】

【0002】

特定の複素環アルカノール誘導体を殺菌剤および／または成長調節剤として作物保護で用いることが可能であることは既に知られている(E P-A 0 3 9 5 1 7 5、E P-A 0 4 0 9 4 1 8 参照)。

30

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献1】 E P-A 0 3 9 5 1 7 5

【特許文献2】 E P-A 0 4 0 9 4 1 8

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

現代の有効成分、例えば殺菌剤に対する生態的および経済的要求が、例えば活性スペクトラム、毒性、選択性、施用量、残留物生成および有利な製造に関して常に高まっており、例えば抵抗性に関する問題もあることから、少なくとも一部の分野で公知の組成物に勝る利点を有する新規な殺菌剤組成物を開発することが常に望まれている。

40

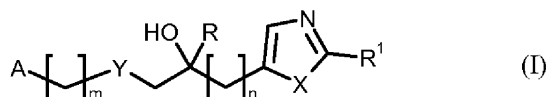
【課題を解決するための手段】

【0005】

下記式(I)の新規な複素環アルカノール誘導体およびその農芸化学的に活性な塩が見出された。

【0006】

【化 1】



式中、

XはOまたはSであり、

YはO、 $-\text{CH}_2-$ または直接結合であり、

mは0または1であり、

nは0または1であり、

Rは、各場合で置換されていても良いアルキル、アルケニル、シクロアルキルまたはアリールであり、

R^1 は、水素、SH、アルキルチオ、アルコキシ、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルキルチオ、ハロアルコキシ、シアノ、ニトロまたはSi(アルキル)₃であり、

Aは、各場合でジ- Z -置換されたフェニルまたはナフチルであり、前記2個の置換基Zは同一であるか異なっており、

Zは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、OH、SH、C(アルキル)(=NOアルキル)、 C_3-C_7 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -ハロアルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_2-C_4 -ハロアルキニル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルスルホニル、ホルミル、 C_2-C_5 -アルキルカルボニル、 C_2-C_5 -ハロアルキルカルボニル、 C_2-C_5 -アルコキシカルボニル、 C_2-C_5 -ハロアルコキシカルボニル、 C_3-C_6 -アルケニルオキシ、 C_3-C_6 -アルキニルオキシ、 C_2-C_5 -アルキルカルボニルオキシ、 C_2-C_5 -ハロアルキルカルボニルオキシ、トリアルキルシリル、または各場合でハロゲン-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-または C_2-C_4 -アルキルカルボニルでモノ置換されていても良いフェニル、フェノキシまたはフェニルチオである。

【0007】

このようにして得ることができる塩も同様に、殺菌性および／または植物成長調節性を有する。

【発明を実施するための形態】

【0008】

本発明に従って使用可能な複素環アルカノール誘導体は、式(I)によって概括的に定義される。上記および下記で言及される式についての好ましい基の定義を下記に示す。これらの定義は、式(I)の最終生成物および全ての中間体に等しく適用される(「方法および中間体の説明」の項目で下記も参照する。)

【0009】

Xは好ましくはSである。

【0010】

Xは同様に好ましくはOである。

【0011】

Yは好ましくはOである。

【0012】

Yは同様に好ましくは $-\text{CH}_2-$ である。

【0013】

Yは同様に好ましくは直接結合である。

【0014】

Yはより好ましくはOである。

【0015】

Yは同様により好ましくは $-CH_2-$ である。

【0016】

mは好ましくは0である。

【0017】

mは同様に好ましくは1である。

【0018】

nは好ましくは0である。

【0019】

nは同様に好ましくは1である。

10

【0020】

Rは好ましくは、各場合で分岐していても良い C_3-C_7 -アルキル、 C_1-C_8 -ハロアルキル、 C_2-C_7 -アルケニル、 C_2-C_7 -ハロアルケニル；ハロゲン-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ-または C_1-C_4 -アルキルチオ-置換されていても良い C_3-C_7 -シクロアルキル；およびモノからトリ-ハロゲン-または C_1-C_4 -アルキル-置換されていても良いフェニルである。

【0021】

Rはより好ましくは、各場合で分岐していても良い C_3-C_5 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_5 -アルケニル、 C_3-C_5 -ハロアルケニル；ハロゲン-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ-、 C_1-C_4 -アルコキシ-、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ-または C_1-C_4 -アルキルチオ-置換されていても良い C_3-C_6 -シクロアルキルである。

20

【0022】

Rは最も好ましくは、tert-ブチル、イソプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-フルオロシクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、1-メトキシシクロプロピル、1-メチルチオシクロプロピル、1-トリフルオロメチルシクロプロピル、(3E)-4-クロロ-2-メチルブト-3-エン-2-イル、 C_1-C_4 -ハロアルキルである。

【0023】

R^1 は好ましくは、水素、SH、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルコキシまたはハロゲンである。

30

【0024】

R^1 はより好ましくは、水素、SH、メチルチオ、エチルチオ、メトキシ、エトキシ、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素である。

【0025】

Aは好ましくは、ジ-Z-置換されたフェニルであり、2個の置換基Zは同一であるか異なっている。

【0026】

Aはより好ましくは、2-および4-Z-置換されたフェニルであり、2個の置換基Zは同一であるか異なっている。

40

【0027】

Aは同様により好ましくは、3-および4-Z-置換されたフェニルであり、2個の置換基Zは同一であるか異なっている。

【0028】

Aは同様により好ましくは、3-および5-Z-置換されたフェニルであり、2個の置換基Zは同一であるか異なっている。

【0029】

Aは好ましくは、ジ-Z-置換されたナフチルであり、2個の置換基Zは同一であるか異なっている。

【0030】

50

Aはより好ましくは、ジ- Z -置換された1-ナフチルであり、2個の置換基 Z は同一であるか異なっている。

【0031】

Aは同様により好ましくは、ジ- Z -置換された2-ナフチルであり、2個の置換基 Z は同一であるか異なっている。

【0032】

Z は好ましくは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C(C_1-C_5\text{-アルキル}) (=NO(C_1-C_5\text{-アルキル}))$ 、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -ハロアルキルチオ、 C_2-C_4 -アルケニル、 C_2-C_4 -アルキニル、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_2-C_5 -アルキルカルボニル、 C_2-C_5 -アルコキシカルボニル、 C_3-C_6 -アルケニルオキシ、 C_3-C_6 -アルキニルオキシ、 C_2-C_5 -アルキルカルボニルオキシ、または各場合でハロゲン-、 C_1-C_4 -アルキル-、 C_1-C_4 -ハロアルキル-、 C_1-C_4 -アルコキシ-もしくは C_2-C_4 -アルキルカルボニル-モノ置換されていても良いフェニル、フェノキシまたはフェニルチオである。

10

【0033】

Z はより好ましくは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C(C_1-C_4\text{-アルキル}) (=NO(C_1-C_4\text{-アルキル}))$ 、 C_3-C_6 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_2 -ハロアルキル、 C_1-C_2 -アルコキシ、 C_1-C_2 -ハロアルコキシ、 C_1-C_2 -アルキルチオ、 C_1-C_2 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_2 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_2 -アルキルスルホニル、アセチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルカルボニルオキシ、または各場合でハロゲン-、 C_1-C_2 -アルキル-、 C_1-C_2 -ハロアルキル-、 C_1-C_2 -アルコキシ-、アセチル-モノ置換されていても良いフェニル、フェノキシまたはフェニルチオである。

20

【0034】

Z は最も好ましくは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、 $CH(=NOMe)$ 、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -、 i -、 s -もしくは t -ブチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、ジフルオロクロロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、または各場合でフッ素-、塩素-、臭素-、ヨウ素-、メチル-、エチル-、トリフルオロメチル-、トリクロロメチル-、ジフルオロメチル-、ジクロロメチル-、ジフルオロクロロメチル-、メトキシ-、アセチル-モノ置換されていても良いフェニル、フェノキシまたはフェニルチオである。

30

【0035】

しかしながら、一般用語で上記で示され、好ましい範囲内で言及されている基の定義および説明を、所望に応じて互いに組み合わせることもでき、すなわち特定の範囲と好ましい範囲との間で組み合わせることができる。それらは最終生成物とそれに応じて前駆体および中間体の両方に適用される。さらに、個々の定義が適用されなくとも良い。

40

【0036】

好ましいものは、各基が上記の好ましい定義を有する式(I)の化合物である。

【0037】

特に好ましいものは、各基が上記のより好ましい定義を有する式(I)の化合物である。

【0038】

非常に好ましいものは、各基が上記の最も好ましい定義を有する式(I)の化合物である。

【0039】

Y が酸素である式(I)の化合物も好ましい。

50

【0040】

Yが $-CH_2-$ である式(I)の化合物も好ましい。

【0041】

Yが直接結合である式(I)の化合物も好ましい。

【0042】

Rが t -ブチルである式(I)の化合物も好ましい。

【0043】

Rが1, 3-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-イルである式(I)の化合物も好ましい。

【0044】

Rが1-メチルシクロプロピルである式(I)の化合物も好ましい。

10

【0045】

Rが1-フルオロシクロプロピルである式(I)の化合物も好ましい。

【0046】

Rが1-クロロシクロプロピルである式(I)の化合物も好ましい。

【0047】

Rがイソプロピルである式(I)の化合物も好ましい。

【0048】

Rが1-メチルシクロヘキシルである式(I)の化合物も好ましい。

【0049】

nが0である式(I)の化合物も好ましい。

20

【0050】

nが1である式(I)の化合物も好ましい。

【0051】

Xが硫黄である式(I)の化合物も好ましい。

【0052】

R^1 が水素である式(I)の化合物も好ましい。

【0053】

R^1 がSHである式(I)の化合物も好ましい。

【0054】

上記で言及の基の定義は、所望に応じて互いに組み合わせることができる。さらに、個々の定義を適用しなくても良い。

30

【0055】

上記の式にある記号の定義では、下記の置換基の代表的なものである総称を用いた。

【0056】

ハロゲン：(ハロアルキル、ハロアルコキシなどの組み合わせも含む) フッ素、塩素、臭素およびヨウ素；

アルキル：(アルキルチオ、アルコキシなどの組み合わせも含む) 1から8個の炭素原子を有する飽和の直鎖もしくは分岐ヒドロカルビル基、例えばメチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル、1, 1-ジメチルエチル、ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2, 2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、ヘキシル、1, 1-ジメチルプロピル、1, 2-ジメチルプロピル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1, 1-ジメチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、3, 3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1, 1, 2-トリメチルプロピル、1, 2, 2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピルおよび1-エチル-2-メチルプロピル；ヘプチル、オクチルなどの C_{1-C_6} -アルキル；

40

ハロアルキル：(ハロアルキルチオ、ハロアルコキシなどの組み合わせも含む) 基における水素原子の一部または全てが上記で記載のようにハロゲン原子によって置き換わって

50

いても良い1から8個の炭素原子を有する（上記で記載のように）直鎖もしくは分岐のアルキル基、例えばクロロメチル、ブromoメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、1-クロロエチル、1-ブromoエチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2-ジフルオロエチル、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチルおよび1, 1, 1-トリフルオロプロ-2-イルなどのC₁-C₃-ハロアルキル。

【0057】

アルケニル：2から8個の炭素原子およびいずれかの位置の1個の二重結合を有する不飽和の直鎖もしくは分岐ヒドロカルビル基、例えばエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチルエテニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-1-ブテニル、2-メチル-1-ブテニル、3-メチル-1-ブテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1, 1-ジメチル-2-プロペニル、1, 2-ジメチル-1-プロペニル、1, 2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-1-ペンテニル、2-メチル-1-ペンテニル、3-メチル-1-ペンテニル、4-メチル-1-ペンテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1, 1-ジメチル-2-ブテニル、1, 1-ジメチル-3-ブテニル、1, 2-ジメチル-1-ブテニル、1, 2-ジメチル-2-ブテニル、1, 2-ジメチル-3-ブテニル、1, 3-ジメチル-1-ブテニル、1, 3-ジメチル-2-ブテニル、1, 3-ジメチル-3-ブテニル、2, 2-ジメチル-3-ブテニル、2, 3-ジメチル-1-ブテニル、2, 3-ジメチル-2-ブテニル、2, 3-ジメチル-3-ブテニル、3, 3-ジメチル-1-ブテニル、3, 3-ジメチル-2-ブテニル、1-エチル-1-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-1-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1, 1, 2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、1-エチル-2-メチル-1-プロペニルおよび1-エチル-2-メチル-2-プロペニルなどのC₂-C₆-アルケニル。

【0058】

シクロアルキル：シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチルおよびシクロオクチルなどの3から8個の炭素環員を有する単環式飽和ヒドロカルビル基。

【0059】

アリール：置換されていないか置換された芳香族の単環、二環または三環、例えばフェニル、ナフチル、アントラセニル（アントリル）、フェンアントラセニル（フェナントリル）。

【0060】

ヘタリール：4個以下の窒素原子あるいは1個の窒素原子と2個以下のN、OおよびSから選択される別のヘテロ原子を含む置換されていないか置換された不飽和の複素5から7員環：例えば2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、2-ピロリル、3-ピロリル、1-ピロリル、3-ピラゾリル、4-ピラゾリル、5-ピラゾリル、1-

10

20

30

40

50

ピラゾリル、1H-イミダゾール-2-イル、1H-イミダゾール-4-イル、1H-イミダゾール-5-イル、1H-イミダゾール-1-イル、2-オキサゾリル、4-オキサゾリル、5-オキサゾリル、2-チアゾリル、4-チアゾリル、5-チアゾリル、3-イソオキサゾリル、4-イソオキサゾリル、5-イソオキサゾリル、3-イソチアゾリル、4-イソチアゾリル、5-イソチアゾリル、1H-1, 2, 3-トリアゾール-1-イル、1H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル、1H-1, 2, 3-トリアゾール-5-イル、2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル、2H-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル、1H-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル、1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル、1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル、4H-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル、4H-1, 2, 4-トリアゾール-4-イル、1H-テトラゾール-1-イル、1H-テトラゾール-5-イル、2H-テトラゾール-2-イル、2H-テトラゾール-5-イル、1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル、1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル、1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル、1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル、1, 2, 3-オキサジアゾール-4-イル、1, 2, 3-オキサジアゾール-5-イル、1, 2, 3-チアジアゾール-4-イル、1, 2, 3-チアジアゾール-5-イル、1, 2, 5-オキサジアゾール-3-イル、1, 2, 5-チアジアゾール-3-イル、2-ピリジニル、3-ピリジニル、4-ピリジニル、3-ピリダジニル、4-ピリダジニル、2-ピリミジニル、4-ピリミジニル、5-ピリミジニル、2-ピラジニル、1, 3, 5-トリアジン-2-イル、1, 2, 4-トリアジン-3-イル、1, 2, 4-トリアジン-5-イル、1, 2, 4-トリアジン-6-イル。

10

20

【0061】

方法および中間体の説明

式(I)の複素環アルカノール誘導体は、各種方法で製造することができる(EP-A 0409418参照)。最初に、可能な方法を下記に模式的に示してある。別段の断りがない限り、記載の基はそれぞれ上記で定義された通りである。

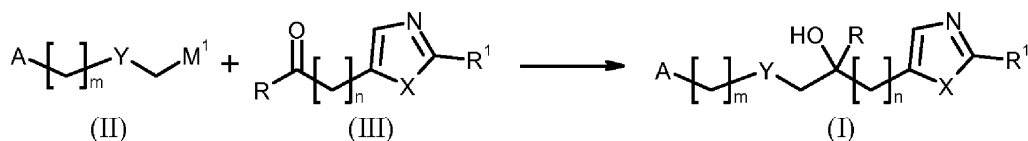
【0062】

図式1：方法A

【0063】

【化2】

30



M¹は金属または金属ハライド、例えばリチウム、マグネシウム(Mg-Hal、Hal=ハロゲン)、チタン[Ti(OAlk)₃、Alk=C₁-C₄-アルキル]である。

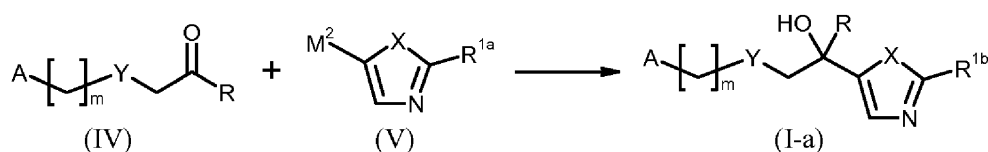
【0064】

図式2：方法B (n=0)

【0065】

【化3】

40



M²は金属、例えばリチウムである。

【0066】

R^{1a}は塩素およびSi(アルキル)₃である。

【0067】

50

【 0 0 6 8 】

【 0 0 6 9 】

【化 4】



【 0 0 7 0 】

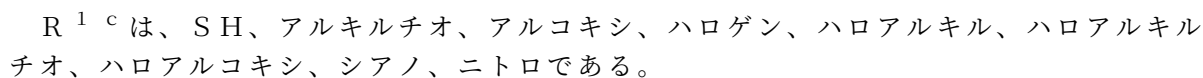
【 0 0 7 1 】

【化 5】



【 0 0 7 2 】

【化 6】

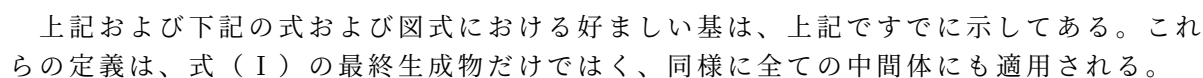


【 0 0 7 3 】

30

【 0 0 7 4 】

【化 7】



【 0 0 7 5 】

40

本発明による方法Aの実施における原料として必要な式(I I)の化合物の一部は公知である。それらは、公知の方法で製造することもできる(Z. Anorg. Allg. Chem. 2001, 627, 2408-2412参照)。

【 0 0 7 6 】

本発明による方法Aの原料としてやはり必要な式(III)のケトンも公知である(E P-A 0 4 0 9 4 1 8 参照)。

【 0 0 7 7 】

本発明による方法Aは代表的には、 -80°C から $+80^{\circ}\text{C}$ の温度で、希釈剤、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフランまたはジクロロメタンの存在下に行う。得られた生成物を、プロトン供与体によって捕捉する。

【0078】

この本発明の反応は好ましくは、特に窒素またはアルゴンなどの不活性ガス下に行う。

【0079】

方法B

本発明による方法Bの実施で原料として要求される式(IV)のケトンの一部は公知である。それらは公知の方法で製造することができる(EP-A0409418参照)。

【0080】

本発明による方法Bの原料としてやはり必要な式(V)の有機金属複素環は公知である(EP-A0409418およびEP-A0395175参照)。

【0081】

式(V)の有機金属複素環の製造の場合、2位に好適な保護基、例えばトリメチルシリルを設けて、M²を5位に指向させることが有利な場合がある。必要というわけではないが、式(IV)のケトンとの反応の前に、この保護基を脱離させることができる。

【0082】

本発明による方法Bは代表的には、-120℃から+80℃の温度で希釈剤、例えばテトラヒドロフランまたはジエチルエーテルの存在下に行う。得られた生成物を、プロトン供与体で捕捉する。この本発明の反応は好ましくは、特に窒素もしくはアルゴンなどの不活性ガス下で行う。

【0083】

方法C

本発明による方法Cの実施で原料として必要な式(VII)の化合物は公知である。

【0084】

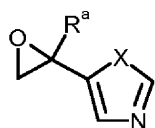
本発明による方法Cの原料としてやはり必要な式(VIII)のオキシラン誘導体の一部は公知である。

【0085】

新規なオキシラン誘導体は、下記式(VIII-a)の化合物である。

【0086】

【化8】



(VIII-a)

式中、

Xは上記で定義の通りであり、

R^aは各場合で、置換されていても良いアルキル(XがSである場合はtert-ブチルを除外)、アルケニル、シクロアルキルまたはアリールである。

【0087】

R^aは好ましくは各場合で、分岐していても良いC₃-C₇-アルキル(XがSである場合はtert-ブチルを除外)、C₁-C₈-ハロアルキル、C₂-C₇-アルケニル、C₂-C₇-ハロアルケニル；ハロゲン-、C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-ハロアルキル-、C₁-C₄-アルコキシ-、C₁-C₄-ハロアルコキシ-、C₁-C₄-ハロアルキルチオ-またはC₁-C₄-アルキルチオ-置換されていても良いC₃-C₇-シクロアルキル；およびモノからトリ-ハロゲン-または-C₁-C₄-アルキル-置換されていても良いフェニルである。

【0088】

R^aはより好ましくは各場合で、分岐していても良いC₃-C₅-アルキル(tert-ブチルを除く)、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₅-アルケニル、C₃-C₅-ハロアルケニル；ハロゲン-、C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-ハロアルキル-、C₁-C₄-アルコキシ-、C₁-C₄-ハロアルコキシ-、C₁-C₄-ハロアルキルチオ-またはC₁-C₄-アルキルチオ-置換されていても良いC₃-C₆-シクロアル

10

20

30

40

50

キルである。

【0089】

R^aは最も好ましくは、イソプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-フルオロシクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、1-メトキシシクロプロピル、1-メチルチオシクロプロピル、(3E)-4-クロロ-2-メチルブト-3-エン-2-イル、C₁-C₄-ハロアルキルである。

【0090】

式(VIII-a)の新規なオキシラン誘導体も同様に、本発明の主題の一部を構成する。

【0091】

本発明による方法Cは、希釈剤、例えばN,N-ジメチルホルムアミドの存在下に、および場合により塩基、例えば水素化ナトリウムまたは炭酸カリウムの存在下に実施される。

【0092】

方法D

本発明による方法Dを実施する上での原料として必要な式(IX)のオキシラン誘導体の一部は公知である(EP-A0121171参照)。

【0093】

2-クロロ-1,3-チアゾール(X)は公知である。

【0094】

IXの変換においては、有機金属化合物、特にアルキルリチウム化合物(例えばn-ブチルリチウム)を用いることが可能である(EP-A0395175参照)。

【0095】

本発明による方法Dは代表的には、希釈剤、例えばテトラヒドロフランまたはジエチルエーテルの存在下に、-120℃から+80℃の温度で行う。得られた生成物はプロトン供与体で捕捉される。

【0096】

この本発明の反応は好ましくは、特に窒素もしくはアルゴンなどの不活性ガス下で行う。

【0097】

方法E

上記の方法で製造可能な式(I-d)の化合物はさらに、一般構造(I-e)の標的化合物に変換することができる。

【0098】

式(I-d)の化合物の変換においては、有機金属化合物、特にアルキルリチウム化合物(例えばn-ブチルリチウム)を用いることが可能である(EP-A0906292参照)。

【0099】

中間体として生成する有機金属化合物は代表的には、求電子体(例えば硫黄、アルキルハライド、ハロゲン間化合物)と反応させて、標的化合物(I-e)を得る。

【0100】

本発明による方法Eは代表的には、希釈剤、例えばテトラヒドロフランまたはジエチルエーテルの存在下に、-120℃から+80℃の温度で行う。得られた生成物はプロトン供与体で捕捉される。

【0101】

この本発明の反応は好ましくは、特に窒素もしくはアルゴンなどの不活性ガス下で行う。

【0102】

方法F

上記の方法で製造可能な式(I-f)の化合物はさらに、一般構造(I-d)の標的化

10

20

30

40

50

合物に変換することができる。

【0103】

式(I-f)の化合物の変換においては、金属、好ましくは亜鉛を用いることが可能である(EP-A0395175参照)。

【0104】

本発明による方法Fは代表的には、希釈剤、例えばテトラヒドロフランまたは有機酸、例えば酢酸の存在下に、-120℃から+150℃の温度で行う。

【0105】

一般式(I)の本発明の複素環アルカノール誘導体は、酸付加塩または金属塩錯体に変換することができる。

10

【0106】

一般式(I)の化合物の生理的に許容される酸付加塩の製造においては、ハロゲン化水素酸、例えば塩酸および臭化水素酸、特に塩酸、そしてさらにはリン酸、硝酸、硫酸、1官能性および2官能性カルボン酸およびヒドロキシカルボン酸類、例えば酢酸、マレイン酸、コハク酸、フマル酸、酒石酸、クエン酸、サリチル酸、ソルビン酸、乳酸、およびスルホン酸類、例えばp-トルエンスルホン酸および1,5-ナフタレンジスルホン酸という酸が好ましい選択肢である。

【0107】

一般式(I)の化合物の酸付加塩は、塩を形成するための一般的な方法によって、例えば好適な不活性溶媒に一般式(I)の化合物を溶かし、酸、例えば塩酸を加えることで簡単に得ることができ、公知の方法で、例えばそれを濾過することで単離することができ、不活性有機溶媒で洗浄することで精製しても良い。

20

【0108】

一般式(I)の化合物の金属塩錯体の製造において、好ましい選択肢は、周期律表の主族IIからIVならびに遷移族IおよびIIおよびIVからVIIの金属の塩であり、例としては銅、亜鉛、マンガン、マグネシウム、スズ、鉄およびニッケルである。

【0109】

塩の有用なアニオンには、好ましくは、ハロゲン化水素酸、例えば塩酸および臭化水素酸、さらにはリン酸、硝酸および硫酸という酸から誘導されるものなどがある。

【0110】

一般式(I)の化合物の金属塩錯体は、一般的な方法によって、例えばアルコール、例えばエタノールに金属塩を溶かし、その溶液を一般式Iの化合物に加えることによって簡単に得ることができる。金属塩錯体は、公知の方法で、例えば濾過することで単離することができ、再結晶によって精製しても良い。

30

【0111】

本発明はさらに、本発明の有効成分を含む、望ましくない微生物、特に望ましくない真菌を防除するための作物保護組成物に関するものである。これらは好ましくは農業的に好適な補助剤、溶媒、担体、界面活性剤または増量剤を含む殺菌剤組成物である。

【0112】

本発明はさらに、望ましくない微生物を防除する方法において、本発明の有効成分を植物病原性真菌および/またはその生息場所に施用することの特徴とする方法に関するものである。

40

【0113】

本発明によれば、担体は、特に植物または植物部分または種子への施用において、より良好な施用を行うために有効成分と混合または組み合わせられる天然もしくは合成の有機もしくは無機物質である。担体は固体または液体であることができ、通常は不活性であり、農業での使用に好適なものでなければならない。

【0114】

有用な固体または液体担体には、例えば、アンモニウム塩およびカオリン類、粘土類、タルク、チョーク、石英、アタパルガイト、モンモリロナイトまたは珪藻土などの天然岩

50

粉および微粉碎シリカ、アルミナおよび天然もしくは合成シリケート類などの合成岩粉、樹脂類、ロウ類、固体肥料、水、アルコール類、特にブタノール、有機溶媒、鉱油および植物油およびこれらの誘導体などがある。そのような担体の混合物も同様に使用可能である。粒剤用の有用な固体担体には、例えば方解石、大理石、軽石、海泡石、ドロマイトなどの破碎および分別された天然岩石ならびに無機および有機ミールの合成顆粒およびおがくず、ヤシ殻、トウモロコシ穂軸およびタバコ茎などの有機材料の顆粒などがある。

【0115】

有用な液化ガス増量剤または担体は、標準温度および標準圧では気体である液体であり、例えば、エアロゾル噴射剤、例えばハロ炭化水素、さらにはブタン、プロパン、窒素および二酸化炭素が挙げられる。

10

【0116】

製剤では、カルボキシメチルセルロース、粉末、顆粒またはアラビアガム、ポリビニルアルコールおよびポリ酢酸ビニルなどのラテックスの形態での天然および合成ポリマー類、またはセファリン類およびレシチン類などの天然リン脂質および合成リン脂質などの粘着付与剤を用いることができる。別の添加剤には鉱油および植物油があり得る。

【0117】

使用される増量剤が水である場合、例えば、補助溶媒として有機溶媒を用いることも可能である。実質的に、有用な液体溶媒は、キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレン類などの芳香族化合物、そしてクロロベンゼン類、クロロエチレン類またはジクロロメタンなどの塩素化芳香族化合物または塩素化脂肪族炭化水素基、シクロヘキサンまたはパラフィン類などの脂肪族炭化水素基、例えば鉱油留分、鉱油および植物油、ブタノールもしくはグリコールなどのアルコール類およびそれらのエーテル類およびエステル類、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンもしくはシクロヘキサノンなどのケトン類、ジメチルホルムアミドおよびジメチルスルホキシドなどの強極性溶媒および水である。

20

【0118】

本発明の組成物は、例えば界面活性剤などの別の成分をさらに含むことができる。有用な界面活性剤は、乳化剤および／または発泡剤、分散剤またはイオン性もしくはノニオン性を有する湿展剤、またはこれら界面活性剤の混合物である。これらの例は、ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸またはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキサイドと脂肪族アルコール類もしくは脂肪酸もしくは脂肪族アミン類との重縮合物、置換フェノール類（好ましくはアルキルフェノール類またはアリールフェノール類）、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導体（好ましくはタウリン酸アルキル）、ポリエトキシ化アルコール類またはフェノールのリン酸エステル、多価アルコールの脂肪族エステル、および硫酸エステル、スルホン酸エステルおよびリン酸エステルを含む化合物の誘導体、例えばアルキルアリールポリグリコールエーテル類、スルホン酸アルキル類、硫酸アルキル類、スルホン酸アリール類、タンパク質加水分解物、リグノ亜硫酸廃液およびメチルセルロースである。有効成分のうちの一つおよび／または不活性担体のうちの一つが水に不溶であり、施用を水系で行う場合には、界面活性剤が存在する必要がある。界面活性剤の割合は、本発明の組成物の5から40重量%である。

30

40

【0119】

無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタンおよびプルシアンブルーなどの色素およびアリザリン色素、アゾ色素および金属フタロシアニン色素などの有機色素および鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩などの微量栄養素を用いることが可能である。

【0120】

適切であれば、他の別の成分が存在していても良く、例えば保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、チキソトロピー物質、浸透剤、安定剤、金属イオン封鎖剤、錯体形成剤である。概して、有効成分は、製剤用に一般に使用される固体もしくは液体添加剤と組み合わせることができる。

50

【0121】

本発明の組成物および製剤は、0.05から99重量%、0.01から98重量%、好ましくは0.1から95重量%、より好ましくは0.5から90%の有効成分、最も好ましくは10から70重量%を含む。

【0122】

本発明の有効成分または組成物は、そのまま用いることができるか、それらの特定の物理的および／または化学的特性に応じて、それらの製剤またはそれから製造される使用形態で用いることができ、例えばエアロゾル、カプセル懸濁液、低温フォギング(cold-fogging)濃縮物、温フォギング(warm-fogging)濃縮物、カプセル化粒剤、微細粒剤、種子処理用のフロアブル製剤、即時使用液剤、粉剤、乳剤、水中油型乳濁液、油中水型乳濁液、巨大顆粒、微細顆粒、油分散性粉剤、油混和性フロアブル製剤、油混和性液体、発泡剤、ペースト、農薬コートした種子、懸濁濃縮液、サスポエマルジョン濃縮液、可溶性濃縮液、懸濁液、水和剤、可溶性粉末、ダスト剤および粒剤、水溶性の粒剤もしくは錠剤、種子処理用の水溶性粉剤、水和剤、天然物および有効成分で含浸させた合成物質、ならびに種子用のポリマー物質およびコーティング材料中のマイクロカプセル、ならびにULV低温フォギングおよび温フォギング製剤がある。

10

【0123】

上記の製剤は、それ自体公知の方法で、例えば有効成分を少なくとも1種類の一般的な増量剤、溶媒もしくは希釈剤、乳化剤、分散剤および／または結合剤または固定剤、湿展剤、撥水剤、適切な場合には乾燥剤およびUV安定剤ならびに適切な場合は色素および顔料、消泡剤、保存剤、二次増粘剤、接着剤、ジベレリン類、さらに別の加工補助剤とを混合することで製造することができる。

20

【0124】

本発明の組成物には、即時使用され、好適な装置を用いて植物もしくは種子に施用することができる製剤だけでなく、使用前に水で希釈しなければならない商業的濃縮物も含まれる。

【0125】

本発明の有効成分はそれ自体で存在することができるか、その(商業的)製剤および殺虫剤、誘引剤、滅菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、成長調節剤、除草剤、肥料、薬害軽減剤および／または情報物質などの他の(公知の)有効成分との混合物としてこれらの製剤から調製される使用形態で存在することができる。

30

【0126】

有効成分または組成物による植物および植物部分の本発明の処理は、一般的な処理方法によって、例えば浸漬、噴霧、霧化、灌水、蒸発、散粉、雲霧、散布、発泡、塗布、展着、散水(灌注)、細流灌漑によって、そして繁殖物の場合、特には種子の場合はさらに乾式種子処理、湿式種子処理、スラリー処理、蓄積、1以上の層によるコーティングなどによって、直接行うか、その環境、生育場所または保管場所への作用によって行う。超微量法によって有効成分を施用するか、有効成分の製剤もしくは有効成分自体を土壌に注入することも可能である。

【0127】

本発明はさらに、種子の処理方法を含む。

40

【0128】

本発明はさらに、前段落に記載の方法の一つによって処理された種子に関するものでもある。本発明の種子は、望ましくない微生物からの種子を保護する方法で用いられる。これらの方法では、少なくとも一つの本発明の有効成分で処理された種子を用いる。

【0129】

本発明の有効成分または組成物は、種子の処理にも適している。有害生物によって引き起こされる作物に対する損傷の大部分が、貯蔵時もしくは播種後、ならびに植物の発芽時および発芽後の種子の感染によって引き起こされる。成長する植物の根および新芽が特に感受性が高く、ごくわずかな損傷であっても植物の枯死に至る可能性があることから、こ

50

の時期は特に重要である。従って、適切な組成物を用いることで、種子および発芽植物を保護することに対する関心が非常に高い。

【0130】

植物の種子を処理することによる植物病原菌の防除についてはかなり以前から知られており、現在もなお改善が続いているテーマである。しかしながら、種子の処理には、常に満足な形で解決できるとは限らない一連の問題が伴う。例えば、植物の植え付け後もしくは発芽後の作物保護組成物の追加施用を行わずに済みますか、少なくとも大幅に減らす、種子および発芽植物の保護方法を開発することが望ましい。そのようにして用いる有効成分の量を至適化することで、使用される有効成分による植物自体に対する損傷を生じることなく、植物病原菌による攻撃から種子および発芽植物を可能な限り最高の保護を行うことがさらに望ましい。特に、種子の処理方法では、遺伝子組み換え植物の固有の殺菌特性も考慮して、作物保護組成物の消費量を最小限としながら、種子および発芽植物の保護を最大とすることを考慮すべきである。

10

【0131】

従って本発明は、本発明の組成物で種子を処理することで、種子および発芽植物を植物病原菌による攻撃から保護する方法に関するものでもある。本発明はさらに、植物病原菌に対して種子および発芽植物を保護するために種子を処理する上での本発明の組成物の使用に関するものでもある。さらに本発明は、植物病原菌に対する保護のために本発明の組成物で処理した種子に関するものでもある。

【0132】

発芽後に植物に損傷を与える植物病原菌の防除は、主として土壌および植物の地上部を作物保護組成物で処理することで行う。作物保護組成物が環境ならびにヒトおよび動物の健康に与える可能性がある影響に関して懸念があるために、施用される有効成分の量を減らすための努力がなされている。

20

【0133】

本発明の利点の一つは、本発明の有効成分および組成物の特定の全身的性質が、これら有効成分および組成物による種子の処理が、植物病原菌から、種子自体を保護するだけでなく、発芽後の得られた植物も保護することを意味する。このようにして、播種時またはその直後の時点での作物の直接処理を行わずに済ませることができる。

【0134】

本発明の有効成分または組成物を特に、種子から成長する植物が病害生物に対して作用するタンパク質を発現する能力を有する遺伝子組み換え種子にも用いることが可能であることも有利であると考えられる。そのような種子を本発明の有効成分もしくは組成物で処理することで、単にタンパク質、例えば殺虫性タンパク質の発現によって、ある種の病害生物を防除することができる。驚くべきことに、この場合にはさらなる相乗効果が認められる可能性があり、その場合には病害生物による攻撃に対する保護の有効性が相加的に高くなる。

30

【0135】

本発明の組成物は、農業、温室、森林、造園およびぶどう園において使用されるあらゆる種類の植物品種の種子を保護するのに適している。特に、これは、穀類（小麦、大麦、ライ小麦、モロコシ／キビおよびカラス麦など）、トウモロコシ、棉、大豆、米、ジャガイモ、ヒマワリ、豆類、コーヒー、ビート（例えば、テンサイおよび飼料用ビート）、ピーナッツ、アブラナ、ケシ、オリーブ、ココナッツ、カカオ、サトウキビ、タバコ、野菜（例えば、トマト、キュウリ、タマネギおよびレタスなど）、芝生および観賞植物（下記も参照）の種子である。穀類（小麦、大麦、ライ小麦、カラス麦など）、トウモロコシおよび米の処理が特に重要である。

40

【0136】

下記でも述べるように、本発明の有効成分または組成物を用いて遺伝子組み換え種子を処理することは、特に重要である。これは、殺虫特性を有するポリペプチドまたはタンパク質の発現を可能とする少なくとも1種の異種遺伝子を含む植物種子に関するものである

50

。遺伝子組み換え種子中の異種遺伝子は、例えばバチルス種 (*Bacillus*)、リゾビウム種 (*Rhizobium*)、シュドモナス種 (*Pseudomonas*)、セッラティア種 (*Serratia*)、トリコデルマ種 (*Trichoderma*)、クラウイバクテル種 (*Clavibacter*)、グロムス種 (*Glomus*) またはグリオクラディウム種 (*Gliocladium*) などの微生物由来であることができる。好ましくは、この異種遺伝子はバチルス種由来であり、その場合に、遺伝子産物はヨーロッパメイズボラー (*European maize borer*) および／またはウエスタンメイズルートワーム (*Western maize rootworm*) に対して有効である。より好ましくは、異種遺伝子はバチルス・トゥリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 由来である。

10

【0137】

本発明の文脈の範囲内で、本発明の組成物は、単独でまたは好適な製剤で種子に施用される。好ましくは、種子は、処理中に損傷が起こらないようにする上で十分安定である状態で処理される。概して、種子の処理は、収穫と播種の間のいずれかの時点で行うことができる。植物から分離され、穂軸、殻、茎、外被、毛または果実の実を含まない種子を用いるのが一般的である。例えば収穫、浄化および乾燥させて含水率15重量%未満とした種子を用いることが可能である。あるいは、乾燥後に、例えば水で処理し、次に再乾燥した種子を用いることも可能である。

【0138】

種子を処理する場合、種子に施用される本発明の組成物の量および／または別の添加剤の量を、種子の発芽に悪影響がないか、得られる植物に損傷がないように選択するよう注意を払う必要がある。これについては特に、ある一定の施用量で植物毒性を有し得る有効成分の場合には特に留意すべきである。

20

【0139】

本発明の組成物は直接施用することができる、すなわち他の成分を含んだり、希釈せずに施用することができる。通常、好適な製剤の形で種子に組成物を施用することが好ましい。好適な製剤および種子処理方法は当業者には公知であり、例えば下記の文書US 4, 272, 417、US 4, 245, 432、US 4, 808, 430、US 5, 876, 739、US 2003/0176428 A1、WO 2002/080675、WO 2002/028186に記載されている。

30

【0140】

本発明に従って使用することができる有効成分は、液剤、乳濁液、懸濁液、粉剤、泡剤、スラリーまたは種子用の他のコーティング組成物などの一般的な種子被覆製剤およびULV製剤に変換することができる。

【0141】

これらの製剤は、公知の方法で、有効成分を例えば、一般的な増量剤などの一般的な添加剤、さらには溶媒もしくは希釈剤、色素、湿展剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、保存剤、二次増粘剤、粘着剤、ジベレリン類および水と混合することで製造される。

【0142】

本発明に従って用いることができる種子被覆製剤中に存在させることができる有用な色素には、そのような目的に一般的な全ての色素がある。水溶解度が非常に低い顔料または水に可溶性色素を用いることができる。例としては、ローダミンB、C、I、ピグメントレッド112およびC、I、ソルベントレッド1の名称で知られる色素などがある。

40

【0143】

本発明に従って用いることができる種子被覆製剤中に存在させることができる有用な湿展剤には、濡れを促進し、活性な農芸化学成分の製剤に従来使用される物質がある。好ましいものは、アルキルナフタレンスルホネート類、例えばジイソプロピルもしくはジイソブチルナフタレンスルホネートである。

【0144】

本発明に従って用いることができる種子被覆製剤中に存在させることができる有用な分

50

散剤および／または乳化剤には、活性農芸化学成分の製剤で従来使用される全てのノニオン系、アニオン系およびカチオン系の分散剤である。好ましく使用できるものは、ノニオン系もしくはアニオン系分散剤またはノニオン系もしくはアニオン系分散剤の混合物である。好適なノニオン系分散剤には特には、エチレンオキシド／プロピレンオキシドブロックポリマー類、アルキルフェノールポリグリコールエーテル類およびトリスチリルフェノールポリグリコールエーテル類およびそれらのリン酸化もしくは硫酸化誘導体などがある。好適なアニオン系分散剤は特には、リグノスルホネート類、ポリアクリル酸塩およびアリアルスルホネート／ホルムアルデヒド縮合物である。

【0145】

本発明に従って用いることができる種子被覆製剤中に存在させることができる消泡剤には、活性農芸化学成分の製剤で従来使用される全ての発泡阻害化合物がある。好ましくはシリコン系消泡剤およびステアリン酸マグネシウムを用いることができる。

10

【0146】

本発明に従って使用することができる種子被覆製剤中に存在させることができる保存剤には、農芸化学組成物中でそのような目的で使用可能な全ての物質がある。例としては、ジクロロフェンおよびベンジルアルコールヘミホルマールなどがある。

【0147】

本発明に従って使用することができる種子被覆製剤中に存在させることができる二次増粘剤には、農芸化学組成物中でそのような目的で使用可能な全ての物質がある。好ましい例には、セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサンタン、改質粘土および微粉碎シリカなどがある。

20

【0148】

本発明に従って使用することができる種子被覆製剤中に存在させることができる粘着剤には、種子被覆製品で使用可能な全ての一般的な結合剤がある。好ましい例には、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコールおよびチロースなどがある。

【0149】

本発明に従って使用することができる種子被覆製剤中に存在させることができるジベレリン類は、好ましくはジベレリンA1、A3（＝ジベレリン酸）、A4およびA7であり、ジベレリン酸を使用するのが特に好ましい。ジベレリン類は公知である（R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsebekämpfungsmittel" [Chemistry of Crop Protection Compositions and Pesticides], vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412 参照）。

30

【0150】

本発明に従って用いることができる種子被覆製剤は、トランスジェニック植物の種子を含む非常に広範囲の異なる種子を直接または水で希釈した後に処理するのに用いることができる。この場合、別の相乗効果も、発現によって形成される物質との相互作用で相乗効果が生じる可能性もある。

【0151】

40

本発明に従って用いることができる種子被覆製剤または水を加えることでそれから調製される製剤によって種子を処理するには、従来種子被覆に用いることができる全ての混合ユニットが有用である。具体的には、種子被覆における手順は、種子を混合機に入れ、特定の望ましい量の種子被覆製剤をそれ自体でまたは水で事前に希釈した後に加え、製剤が種子上に均一に分布するまで全てを混合するというものである。適切であれば、それに続いて乾燥操作を行う。

【0152】

本発明の有効成分または組成物は、強い殺菌活性を有し、作物保護および材料保護において、真菌および細菌などの望ましくない微生物を防除するのに用いることができる。

【0153】

50

殺菌剤は、作物保護において、ネコブカビ類（*Plasmodiophoromycetes*）、卵菌類（*Oomycetes*）、ツボカビ類（*Chytridiomycetes*）、接合菌類（*Zygomycetes*）、子囊菌類（*Ascomycetes*）、担子菌類（*Basidiomycetes*）および不完全菌類（*Deuteromycetes*）の防除するのに用いることができる。

【0154】

殺細菌剤は、作物保護において、シュードモナス科（*Pseudomonadaceae*）、リゾビウム科（*Rhizobiaceae*）、腸内細菌科（*Enterobacteriaceae*）、コリネバクテリウム科（*Corynebacteriaceae*）およびストレプトミセス科（*Streptomycetaceae*）の防除に用いることができる。

10

【0155】

本発明の殺菌剤組成物は、植物病原菌の治療的または保護的防除に用いることができる。従って本発明は、種子、植物または植物部分、果実またはその植物が成長する土壤に施用される本発明の有効成分もしくは組成物を用いて植物病原菌を治療的および保護的に防除する方法に関するものである。

【0156】

作物保護における植物病原菌を防除するための本発明の組成物は、有効だが非植物毒性の量の本発明の有効成分を含む。「有効だが、非植物毒性の量」とは、満足できる形で植物の真菌病を防止したり、真菌病を完全に根絶するのに十分であって、同時に植物毒性の症状をほとんど引き起こさない本発明の組成物の量を意味する。この施用量は、一般的には比較的広い範囲で変動し得るものである。それはいくつかの因子、例えば防除対象の真菌、植物、気候条件および本発明の組成物の成分によって決まる。

20

【0157】

有効成分が、植物病害の防除に必要な濃度で植物によって良好に耐容されることから、植物の地上部、栄養繁殖物および種子、ならびに土壤の処理を行うことができる。

【0158】

本発明に従って、全ての植物および植物部分を処理することができる。植物とは、本発明においては、望ましいおよび望ましくない野生植物または作物（天然作物を含む。）のような全ての植物および植物群を意味する。作物は、従来の品種改良および至適化法によって、またはバイオテクノロジーおよび遺伝子工学法によって、またはこれらの方法の組み合わせによって得ることができる植物であることができ、遺伝子導入植物を含み、育成者権によって保護され得るまたは保護され得ない植物品種を含む。植物部分は、芽、葉、花および根のような、地上および地下の植物のあらゆる部分および器官を意味するものと理解すべきであり、例として、葉、針葉、柄、茎、花、子実体、果実、種子、根、塊茎および地下茎などがある。植物部分には、収穫物ならびに栄養繁殖物および生殖繁殖物、例えば、苗木、塊茎、地下茎、切り枝および種子などもある。

30

【0159】

本発明の有効成分は、植物によって良好に耐容され、好ましい恒温動物毒性を有し、環境によって耐容される場合、植物および植物の器官を保護するのに適しており、収穫高を高めるのに適しており、収穫物の品質を高めるのに適している。それらは好ましくは作物保護組成物として用いることができる。それらは、通常は感受性および抵抗性の種に対してならびに発達の全段階もしくは一部の段階に対して活性である。

40

【0160】

本発明に従って処理可能な植物には、次の植物などがある。すなわちワタ、アマ、ブドウ、果実、野菜、例えばバラ科属種（*Rosaceae* sp.）（例えば、リンゴおよびナシのようなナシ状果だけでなく、例えば、アンズ、サクランボ、アーモンドおよびモモのような石果および、例えば、イチゴのような柔らかい果物）、リベシオイダエ科属種（*Ribesioideae* sp.）、クルミ科属種（*Juglandaceae* sp.）、カバノキ科属種（*Betulaceae* sp.）、ウルシ科属種（*Anacard*

50

iaceae sp.）、ブナ科属種（Fagaceae sp.）、クワ科属種（Moraceae sp.）、モクセイ科属種（Oleaceae sp.）、マタタビ科属種（Actinidaceae sp.）、クスノキ科属種（Lauraceae sp.）、バショウ科属種（Musaceae sp.）（例えば、バナナの木およびバナナ植林地）、アカネ科属種（Rubiaceae sp.）（例えば、コーヒー）、ツバキ科属種（Theaceae sp.）、アオギリ科属種（Sterculiaceae sp.）、ミカン科属種（Rutaceae sp.）（例えば、レモン、オレンジおよびグレープフルーツ）、ナス科属種（Solanaceae sp.）（例えば、トマト）、ユリ科属種（Liliaceae sp.）、キク科属種（Asteraceae sp.）（例えば、レタス）、セリ科属種（Umbelliferae sp.）、十字花科属種（Cruciferae sp.）、アカザ科属種（Chenopodiaceae sp.）、ウリ科属種（Cucurbitaceae sp.）（例えば、キュウリ）、ネギ科属種（Alliaceae sp.）（例えば、ネギ、タマネギ）、マメ科属種（Papilionaceae sp.）（例えば、エンドウマメ）；主要作物、例えばイネ科属種（Gramineae sp.）（例えば、トウモロコシ、芝生、例えばコムギ、ライムギ、イネ、オオムギ、オートムギ、キビおよびライコムギなどの穀物）、イネ科属種（Poaceae sp.）（例えば、サトウキビ）、キク科属種（Asteraceae sp.）（例えば、ヒマワリ）、アブラナ科属種（Brassicaceae sp.）（例えば、キャベツ、紫キャベツ、ブロッコリー、カリフラワー、芽キャベツ、青梗菜、コールラビ、ラディッシュならびにセイヨウアブラナ、カラシ、セイヨウワサビおよびクレソン）、マメ科属種（Fabaceae sp.）（例えば、マメ、落花生）、マメ科属種（Papilionaceae sp.）（例えば、ダイズ）、ナス科属種（Solanaceae sp.）（例えば、ジャガイモ）、アカザ科属種（Chenopodiaceae sp.）（例えば、サトウダイコン、飼料用ビート、フダンソウ、アオゲイトウ）；庭および森における有用植物および観賞用植物；ならびにこれらの各植物の遺伝子改変型である。

【0161】

すでに上述したように、本発明に従って、全ての植物および植物部分を処理することが可能である。好ましい実施形態では、野生植物種および植物栽培品種、または異種交配もしくはプロトプラスト融合のような従来の生物育種方法によって得られたもの、ならびにこれらの部分を処理する。さらに好ましい実施形態では、遺伝子工学、適切な場合は、従来の方法と組み合わせて得られたトランスジェニック植物および植物品種（遺伝的改変生物）、ならびにこれらの部分を処理する。「部分」、「植物の部分」または「植物部分」という用語については、すでに上記で説明している。より好ましくは、それぞれ市販されているか使用されている植物品種の植物を、本発明に従って処理する。植物品種とは、従来の品種改良、突然変異誘発または組換えDNA技術によって得られた、新規な特徴（「形質」）を有する植物を意味するものと理解される。これらは、栽培品種、変種、生物型または遺伝子型であることができる。

【0162】

本発明の処理方法は、遺伝子改変した生物（GMOs）、例えば、植物または種子の処理で使用する。遺伝子改変した植物（またはトランスジェニック植物）は、異種遺伝子がゲノム中に安定に組み込まれている植物である。「異種遺伝子」という表現は、本質的に、植物の外側で提供または組み立てられ、かつ、細胞核ゲノム、クロロプラストゲノムまたはミトコンドリアゲノムに導入すると、形質転換された植物に、対象となるタンパク質もしくはポリペプチドを発現することで、またはその植物に存在する他の遺伝子を下方制御またはサイレンシングすることにより（例えば、アンチセンス技術、共抑制技術またはRNAi技術〔RNAi干渉〕を用いる）、新たなもしくは改善された農学的その他の特性を与える遺伝子を意味する。ゲノム中に存在する異種遺伝子は、同様にトランス遺伝子と呼ばれる。植物のゲノム中でのその特異的存在によって定義されるトランス遺伝子は、形質転換またはトランスジェニック事象と呼ばれる。

【0163】

植物種または植物品種、それらの場所および成長条件（土壌、天候、生育期間、栄養）によっては、本発明の処理は、超加算的（「相乗」）効果をもたらすこともある。例えば、実際に起こると予想される効果を超える次に示す効果：施用量の低減および／または活性スペクトルの拡大および／または本発明に従って使用することができる有効成分および組成物の活性の向上、植物成長の改善、高温もしくは低温に対する耐性の向上、干魃または水もしくは土壌の塩含有量に対する耐性向上、開花能の向上、収穫の簡易化、成熟の加速、収穫高の増大、より大きい果実、より高い植物、より濃い緑色の葉、より容易な開花、収穫物の品質向上および／または栄養価の上昇、果実中の高い糖度、収穫物の保存安定性および／または加工性の向上が可能となる。

10

【0164】

一定の施用量では、本発明の有効成分は、植物における増強効果を有する可能性もある。したがって、それらは、望ましくない植物病原菌類および／または微生物および／またはウィルスによる攻撃に対する植物の防御システムの動員に適している。これは、例えば真菌に対する本発明の組み合わせの向上した活性の理由の一つであり得る。植物増強性（抵抗性誘発性）物質は、本願の関連において、続いて望ましくない植物病原菌を接種された場合に、処理される植物が、かなりの程度の望ましくない植物病原菌に対する抵抗性を示すように植物の防御システムを刺激することができる物質または物質の組み合わせも意味するものと理解すべきである。したがって、本発明の物質は、処理後のある一定の時間内に、上記病原体による攻撃から植物を保護するのに使用できる。保護が行われる期間は、有効成分で植物を処理してから、一般には1から10日間、好ましくは1から7日間に及ぶ。

20

【0165】

好ましくは本発明により処理されるべき植物および植物品種には、その植物（育種および／またはバイオテクノロジー的手段によって得られたか否かとは無関係に）に特に有利で有用な形質を付与する遺伝物質を有する全ての植物が含まれる。

【0166】

やはり好ましくは本発明により処理される植物および植物品種は、1以上の生物ストレス因子に対して抵抗性である。すなわち、その植物は、例えば線虫、昆虫、ダニ、植物病原菌、細菌、ウィルスおよび／またはウィロイドなどの有害動物および有害微生物に対するより良好な防御を有する。

30

【0167】

やはり本発明に従って処理可能な植物および植物品種は、1以上の非生物ストレス因子に対して抵抗性である植物である。非生物ストレス条件には、例えば、乾燥、低温曝露、熱曝露、浸透圧ストレス、浸水、土壌塩濃度上昇、ミネラル曝露増加、オゾン曝露、強露光、窒素栄養素利用能の制限、リン栄養素利用能の制限または日陰の忌避などがあり得る。

【0168】

やはり本発明に従って処理することができる植物および植物品種は、収穫特性改善を特徴とする植物である。例えば改善された植物の生理、改善された植物の成長および発達、例えば水利用効率、水保持効率、窒素利用の改善、炭素同化向上、光合成向上、発芽効率上昇および成熟加速の結果、これら植物での収量増加につながり得る。収量はさらに、改善された植物構造（ストレス条件および非ストレス条件下）によって影響され得るものであり、それには、早期開花、ハイブリッド種子製造のための開花制御、苗の活力、植物の大きさ、節間の数および間隔、根の成長、種子の大きさ、果実の大きさ、鞘の大きさ、鞘および穂の数、鞘または穂当たりの種子数、種子の質量、種子充填度の強化、種子裂開の低減、減少した鞘裂開の低減および倒伏耐性などがある。さらなる収量関係の形質には、種子組成、例えば炭水化物含有量、タンパク質含有量、油の含有量および組成、栄養価、非栄養化合物の減少、加工性改善および貯蔵安定性の向上などがある。

40

【0169】

50

本発明により処理され得る植物は、既にヘテロシスまたはハイブリッド効果の特徴を発現するハイブリッド植物であり、それによって、収量、活力、健康および生物ストレスおよび非生物ストレス因子に対する抵抗性がより高くなる。そのような植物は代表的には、同系交配雄性不稔親株（雌親）と別の同系交配雄性稔性親株（雄親）を交雑させることにより作られる。ハイブリッド種子は代表的には、雄性不稔植物から収穫され、栽培者に販売される。雄性不稔植物は、（例えばトウモロコシでは）、雄穂除去、すなわち雄性生殖器官（または雄花）の物理的除去により作ることができる場合があるが、より代表的には、雄性不稔性が、植物ゲノムにおける遺伝的決定基の結果となる。この場合、そして特に種子がハイブリッド植物から収穫するのが望まれる産物である場合に、雄性不稔性の原因となる遺伝的決定因子を含むハイブリッド植物での雄性稔性が十分に回復されるようにすることが有効であるのが普通である。これは、雄性不稔性を担う遺伝的決定基を含むハイブリッド植物で雄性稔性を回復することができる適切な稔性回復遺伝子を雄親が有することによって達成される。雄性不稔性の遺伝的決定基は細胞質に局在化していることができる。細胞質雄性不稔性（CMS）の例としては、アブラナ種の例が記載されていた。しかしながら、雄性不稔性の遺伝的決定基は、細胞核ゲノムに局在化していることもできる。雄性不稔性植物は、遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によっても得ることができる。雄性不稔性植物を得る上で特に好ましい手段は、WO 89/10396に記載されており、そこでは、例えば、バルナーゼなどのリボヌクレアーゼが、雄しべにあるタペータム細胞で選択的に発現される。次に稔性は、バルスターなどのリボヌクレアーゼ阻害剤のタペータム細胞での発現によって回復することができる。

10

20

【0170】

本発明によって処理することができる植物または植物品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られる）は、除草剤耐性植物、すなわち、1以上の所定の除草剤に対して耐性とされた植物である。そのような植物は、形質転換により、またはそのような除草剤耐性を付与する突然変異を含む植物の選択によって得ることができる。

【0171】

除草剤耐性植物は、例えばグリホセート耐性植物、すなわち除草剤であるグリホセートまたはその塩に対して耐性とされた植物である。例えば、グリホセート耐性植物は、酵素5-エノールピルビルシキマート-3-ホスファート合成酵素（EPSPS）をコードする遺伝子で植物を形質転換することで得ることができる。そのようなEPSPS遺伝子の例は、細菌サルモネラ・チフィムリウム（*Salmonella typhimurium*）のAroA遺伝子（突然変異CT7）、細菌アグロバクテリウム属種（*Agrobacterium* sp）のCP4遺伝子、ペチュニアEPSPS、トマトEPSPSもしくはオヒシバ（*Eleusine*）EPSPSをコードする遺伝子である。それは、変異EPSPSであることもできる。グリホセート耐性植物は、グリホセートオキシドレーダクターゼ酵素をコードする遺伝子を発現させることによって得ることもできる。グリホセート耐性植物は、グリホセートアセチルトランスフェラーゼ酵素をコードする遺伝子を発現させることによって得ることもできる。グリホセート耐性植物は、上述の遺伝子の天然突然変異を含む植物を選択することによっても得ることができる。

30

【0172】

他の除草剤耐性植物は、例えば酵素であるグルタミン合成酵素を阻害する除草剤、例えばピアラホス、ホスフィノトリシンまたはグルホシネートに対して耐性とされた植物である。そのような植物は、除草剤を解毒する酵素または阻害に対して耐性である酵素グルタミン合成酵素の突然変異体を発現させることによって得ることができる。一つのそのような有効な解毒性酵素は例えば、ホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼ（例えば、ストレプトミセス（*Streptomyces*）種からのbarまたはpatタンパク質など）をコードする酵素である。外来ホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼを発現する植物も記載されている。

40

【0173】

さらに別の除草剤耐性植物は、酵素ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ（

50

H P P D) を阻害する除草剤に対して耐性にされている植物でもある。ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼは、パラヒドロキシフェニルピルビン酸 (H P P) がホモゲンチジン酸に変換される反応を触媒する酵素である。天然の耐性H P P D酵素をコードする遺伝子または突然変異H P P D酵素をコードする遺伝子を用いて、H P P D阻害剤に対して耐性の植物を形質転換することができる。H P P D阻害剤に対する耐性はまた、H P P D阻害剤による天然H P P D酵素の阻害にもかかわらずホモゲンチジン酸の形成を可能にする、ある種の酵素をコードする遺伝子を用いて植物を形質転換することによっても得ることができる。H P P D耐性酵素をコードする遺伝子に加えて、プレフェン酸デヒドロゲナーゼをコードする遺伝子を用いて植物を形質転換することによって、H P P D阻害剤に対する植物の耐性を改善させることもできる。

10

【0174】

さらに別の除草剤抵抗性植物は、アセト乳酸合成酵素 (A L S) 阻害剤に対して耐性とされた植物である。公知のA L S阻害剤には、例えばスルホニル尿素、イミダゾリノン、トリアゾロピリミジン類、プリミジニルオキシ (チオ) 安息香酸化合物および／またはスルホニルアミノカルボニルトリアゾリノン系除草剤などがある。A L S酵素 (アセトヒドロキシ酸合成酵素、A H A Sとも称される) における各種突然変異が、各種の除草剤または除草剤群に対する耐性を付与することが知られている。スルホニル尿素耐性植物およびイミダゾリノン耐性植物の製造は、国際特許公開WO 1 9 9 6 / 0 3 3 2 7 0に記載されている。さらに別のスルホニル尿素およびイミダゾリノン耐性植物も、例えばWO 2 0 0 7 / 0 2 4 7 8 2に記載されている。

20

【0175】

イミダゾリノンおよび／またはスルホニル尿素に対して耐性である他の植物は、突然変異誘発により、除草剤存在下での細胞培地での選別により、または突然変異育種によって得ることができる。

【0176】

やはり本発明に従って処理することができる植物または植物品種 (遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られる) は、昆虫耐性トランスジェニック植物、すなわち、ある種の標的昆虫による攻撃に対して耐性とした植物である。そのような植物は、形質転換によってまたはそのような昆虫耐性を付与する突然変異を含む植物の選択によって得ることができる。

30

【0177】

本発明の文脈において、「昆虫耐性トランスジェニック植物」という用語には、次のものをコードするコード配列を含む少なくとも一つのトランス遺伝子を含む植物などがある。

【0178】

1) バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 由来の殺虫性結晶タンパク質またはその殺虫性部分、例えばオンライン: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/ にオンラインでまとめられた殺虫性結晶タンパク質またはその殺虫性部分、例えばC r yタンパク質分類C r y 1 A b、C r y 1 A c、C r y 1 F、C r y 2 A b、C r y 3 A eまたはC r y 3 B bのタンパク質またはそれらの殺虫性部分; または

40

2) バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 由来の結晶タンパク質またはバチルス・チューリングエンシス以外の第二の結晶タンパク質またはその部分の存在下で殺虫性であるその部分、例えばC r y 3 4およびC r y 3 5結晶タンパク質から構成される二元毒素; または

3) バチルス・チューリングエンシス由来の2つの異なる殺虫性結晶タンパク質の部分を含むハイブリッド殺虫性タンパク質、例えば、上記1) のタンパク質のハイブリッドまたは上記2) のタンパク質のハイブリッド、例えば、コーン・イベント (c o r n e v e n t) M O N 9 8 0 3 4により産生されるC r y 1 A . 1 0 5タンパク質 (W O 2 0 0 7

50

／027777)；または

4) 標的昆虫種に対するより高い殺虫活性を得るために、および／または、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するために、および／またはクローニングもしくは形質転換時にコードDNAで誘発される変化のために、いくつか、特に1から10のアミノ酸が別のアミノ酸により置換されている上記項目1)から3)のいずれか一つのタンパク質、例えばコーン・イベントMON863またはMON88017におけるCry3Bb1タンパク質またはコーン・イベントMIR604におけるCry3Aタンパク質；または

5) バチルス・チューリングエンシスまたはバチルス・セレウス (*Bacillus cereus*) 由来の殺虫性分泌タンパク質またはその殺虫性部分、例えば http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html で列挙される植物殺虫性タンパク質 (VIP)、例えば、VIP3Aaタンパク質分類からのタンパク質；または

6) バチルス・チューリングエンシスまたはB. セレウス由来の第二の分泌タンパク質存在下で殺虫性であるバチルス・チューリングエンシスまたはバチルス・セレウス由来の分泌タンパク質、例えば、VIP1AおよびVIP2Aタンパク質から構成される二元毒素；

7) バチルス・チューリングエンシスまたはバチルス・セレウス由来の異なる分泌タンパク質からの部分を含むハイブリッド殺虫性タンパク質、例えば上記1)におけるタンパク質のハイブリッドまたは上記2)におけるタンパク質のハイブリッド；または

8) 標的昆虫種に対するより高い殺虫活性を得るために、および／または、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するために、および／またはクローニングもしくは形質転換時にコードDNAで誘発される変化のために、いくつか、特に1から10のアミノ酸が別のアミノ酸により置換されている上記項目1)から3)のいずれかのタンパク質 (なお殺虫性タンパク質をコードしている)、例えば、コットン・イベントCOT102におけるVIP3Aaタンパク質。

【0179】

当然のことながら、本明細書で使用される場合の昆虫耐性トランスジェニック植物には、上記の分類1から8のいずれか一つのタンパク質をコードする遺伝子の組み合わせを含む植物が含まれる。1実施態様において、昆虫耐性植物は、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するため、または同じ標的昆虫種に対して殺虫性があるが異なる作用機序 (例えば、昆虫での異なる受容体結合部位に結合する等) を有する異なるタンパク質を使用することによって植物に対する昆虫の抵抗性発達を遅延させるために、上記の分類1から8のいずれか一つのタンパク質をコードする複数のトランス遺伝子を含む。

【0180】

やはり本発明によって処理することができる植物または植物品種 (遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得たもの) は、非生物ストレス因子に対して耐性である。そのような植物は、形質転換によりまたはそのようなストレス耐性を付与する突然変異を含む植物の選択によって得ることができる。特に有用なストレス耐性植物には以下のものなどがある。

【0181】

a. 植物細胞または植物においてポリ (ADP-リボース) ポリメラーゼ (PARP) 遺伝子の発現および／または活性を低下させることができるトランス遺伝子を含む植物、

b. 植物または植物細胞のPARGコード遺伝子の発現および／または活性を低下させることができるストレス耐性促進トランス遺伝子を含む植物、

c. ニコチンアミダーゼ、ニコチネートホスホリボシルトランスフェラーゼ、ニコチン酸モノヌクレオチドアデニルトランスフェラーゼ、ニコチンアミドアデニンジヌクレオチド合成酵素またはニコチンアミドホスホリボシルトランスフェラーゼなどのニコチンアミドアデニンジヌクレオチドサルベージ生合成経路の植物機能性酵素をコードするストレス耐性促進トランス遺伝子を含む植物。

【0182】

やはり本発明によって処理することができる植物または植物品種 (遺伝子工学などの植

10

20

30

40

50

物バイオテクノロジー法によって得たもの)は、収穫産物の量、品質および／または貯蔵安定性の変化および／または収穫産物の具体的な成分の特性変化も示し、それには下記のものなどがある。

【0183】

1) 物理化学的特性、特にアミロース含有量またはアミロース／アミロペクチン比、分枝度、平均鎖長、側鎖分布、粘性挙動、ゲル強度、デンプンの粒度および／または粒子形態に関して、野生型植物細胞または植物で合成されるデンプンと比較して変化していることで、ある種の用途により適したものとなる改質デンプンを合成するトランスジェニック植物、

2) 非デンプン炭水化物ポリマーを合成する、または遺伝子組み換えなしに野生型植物と比較して特性が変わっている非デンプン炭水化物ポリマーを合成するトランスジェニック植物。例としては、特にイヌリン型およびレバン型のポリフルクトースを産生する植物、 α -1, 4-グルカン類を産生する植物、 α -1, 6-分枝 α -1, 4-グルカン類を産生する植物、およびアルテルナンを産生する植物がある。

【0184】

3) ヒアルロナンを産生するトランスジェニック植物。

【0185】

やはり本発明によって処理することができる植物または植物品種(遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得たもの)は、繊維特性が変化したワタ植物などの植物である。そのような植物は、形質転換によりまたはそのような繊維特性を変化させる突然変異を含む植物の選択により得ることができ、それには下記のものなどがある。

【0186】

- a) 改変型のセルロース合成酵素遺伝子を含むワタ植物などの植物、
- b) 改変型の r s w 2 または r s w 3 相同性核酸を含むワタ植物などの植物、
- c) ショ糖リン酸合成酵素の発現が高くなったワタ植物などの植物、
- d) ショ糖合成酵素の発現が高くなったワタ植物などの植物、
- e) 繊維細胞の根底での原形質連絡制御のタイミングが、例えば繊維選択的 β -1, 3-グルカナーゼの低下によって変化しているワタ植物などの植物、
- f) 例えば n o d C などの N-アセチルグルコサミントランスフェラーゼ遺伝子およびキチン合成遺伝子の発現により、反応性が変わった繊維を有するワタ植物などの植物。

【0187】

やはり本発明によって処理することができる植物または植物品種(遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得たもの)は、油分プロファイルの特徴が変わったセイヨウアブラナまたは関連するアブラナ(B r a s s i c a)植物などの植物である。そのような植物は、形質転換によりまたはそのような油分の特徴を変える突然変異を含む植物の選択によって得ることができ、それには下記のものなどがある。

【0188】

- a) 高いオレイン酸含有量を有する油を産生するセイヨウアブラナ植物などの植物；
- b) 低いリノレン酸含有量を有する油を産生するセイヨウアブラナ植物などの植物；
- c) 低レベルの飽和脂肪酸を有する油を産生するセイヨウアブラナ植物などの植物。

【0189】

本発明によって処理することができる特に有用なトランスジェニック植物は、1以上の毒素をコードする1以上の遺伝子を有する植物であり、次の商品名 Y I E L D G A R D (登録商標)(例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ)、K n o c k O u t (登録商標)(例えば、トウモロコシ)、B i t e G a r d (登録商標)(例えば、トウモロコシ)、B t - X t r a (登録商標)(例えば、トウモロコシ)、S t a r L i n k (登録商標)(例えば、トウモロコシ)、B o l l g a r d (登録商標)(ワタ)、N u c o t n (登録商標)(ワタ)、N u c o t n 3 3 B (登録商標)(ワタ)、N a t u r e G a r d (登録商標)(例えば、トウモロコシ)、P r o t e c t a (登録商標)および N e w L e a f (登録商標)(ジャガイモ)で入手可能なトランスジェニック植物である。挙げる

10

20

30

40

50

べき除草剤耐性植物の例には、次の商品名 Roundup Ready (登録商標) (グリホセート耐性、例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ)、Liberty Link (登録商標) (ホスフィノトリシン耐性、例えば、セイヨウアブラナ)、IMI (登録商標) (イミダゾリノン類耐性) および SCS (登録商標) (スルホニル尿素耐性、例えばトウモロコシ) で販売されているトウモロコシ品種、ワタ品種およびダイズ品種がある。挙げるべき除草剤耐性植物 (除草剤耐性となるよう従来の方法で育種された植物) には、Clearfield (登録商標) の名称 (例えばトウモロコシ) で販売されている品種などがある。

【0190】

本発明により処理することができる特に有用なトランスジェニック植物は、形質転換事象または形質転換事象の組み合わせを含む植物であり、それは例えば各種の国または地域の規制当局からのデータベースに列記されたものである (例えば、http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browser.aspx および <http://www.agbios.com/database.php> を参照する)。

10

【0191】

本発明の有効成分または組成物は、材料保護において、望ましくない微生物、例えば真菌および/または昆虫による感染および破壊に対して工業材料を保護するのに用いることができる。

【0192】

さらに本発明の化合物は、単独でまたは他の有効成分と組み合わせて、防汚剤組成物として用いることができる。

20

【0193】

本発明の文脈での工業材料は、工業用に作られた非生物材料を意味するものと理解すべきである。例えば、本発明の有効成分によって微生物による変化または破壊から保護されるべき工業材料は、接着剤、サイズ、紙、壁紙およびボール紙、テキスタイル、カーペット、皮革、木材、塗料およびプラスチック品、冷却潤滑剤および微生物によって感染もしくは破壊を受け得る他の材料である。微生物の繁殖によって害を受け得る製造工場および建物の一部、例えば冷却水循環路、冷却および加熱システムおよび換気および空調ユニットも、保護されるべき材料の範囲内で言及され得るものである。本発明の範囲内の工業材料には好ましくは、接着剤、サイズ、紙および板、皮革、木材、塗料、冷却潤滑剤および熱伝達液などがあり、より好ましいものは木材である。本発明の有効成分または組成物は、腐敗、劣化、退色、脱色またはかび形成のような不利な作用を防止することができる。さらに、本発明の化合物は、海水または汽水と接触する物品、特に船体、篩、ネット、建築物、係留所および信号システムを汚染から保護するのに用いることができる。

30

【0194】

望ましくない真菌を防除するための本発明の方法は、貯蔵品保護にも用いることができる。貯蔵品とは、長期間の保護が望まれる植物もしくは動物起源の天然物質または天然起源のその加工製品を意味するものと理解される。例えば植物もしくは植物部分などの植物由来の貯蔵品、例えば茎、葉、塊茎、種子、果実、穀粒は、収穫されたばかりで、または (前) 乾燥、加湿、破碎、粉碎、加圧または焙焼による加工形態後に保護することができる。貯蔵品には、建築用材木、電柱および柵などの粗材木または家具などの完成製品の形態の材木との両方も含まれる。動物由来の貯蔵品は、例えば獣皮、皮革、毛皮および毛髪である。本発明の有効成分は、腐食、劣化、変色、退色またはかび形成などの不利な作用を防ぐことができる。

40

【0195】

本発明によって処理することができる真菌疾患の病原体の例には下記のものなどがあるが、これらに限定されるものでない。

【0196】

ウドンコ病の病原体によって引き起こされる病害、例えばブルメリア・グラミニス (*Blumeria graminis*) などのブルメリア (*Blumeria*) 種; ポドス

50

ファエラ・ロイコトリカ (*Podosphaera leucotricha*) などのポドスファエラ (*Podosphaera*) 種; スファエロセカ・フリギネア (*Sphaerotherca fuliginea*) などのスファエロセカ (*Sphaerotherca*) 種; ウンシヌラ・ネケータ (*Uncinula necator*) などのウンシヌラ (*Uncinula*) 種;

さび病病原体によって引き起こされる病害、例えばギムノスポランギウム・サビナエ (*Gymnosporangium sabiniae*) などのギムノスポランギウム (*Gymnosporangium*) 種; ヘミレイア・バスタトリックス (*Hemileia vastatrix*) などのヘミレイア (*Hemileia*) 種; ファコプソラ・パチライジ (*Phakopsora pachyrhizi*) およびファコプソラ・マイボミアエ (*Phakopsora meibomiae*) などのファコプソラ (*Phakopsora*) 種; プッシニア・レコンディタ (*Puccinia recondita*) または プッシニア・トリチシナ (*Puccinia trititica*) などのプッシニア (*Puccinia*) 種; ウロミセス・アッペンディキュラタス (*Uromyces appendiculatus*) などのウロミセス (*Uromyces*) 種;

卵菌類 (*Oomycetes*) 群の病原体によって引き起こされる病害、例えばブレミア・ラクチュカエ (*Bremia lactucae*) などのブレミア (*Bremia*) 種; ペロノスポラ・ピシ (*Peronospora pisi*) または *P. brassicae* などのペロノスポラ (*Peronospora*) 種; フィトフソラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*) などのフィトフソラ (*Phytophthora*) 種; プラスモパラ・ビチコラ (*Plasmopara viticola*) などのプラスモパラ (*Plasmopara*) 種; シュードペロノスポラ・フムリ (*Pseudoperonospora humuli*) または シュードペロノスポラ・キューベンシス (*Pseudoperonospora cubensis*) などのシュードペロノスポラ (*Pseudoperonospora*) 種; ピチウム・ウルティマム (*Pythium ultimum*) などのピチウム (*Pythium*) 種;

以下のものによって引き起こされる葉枯病 (*leaf blotch diseases*) および葉萎凋病 (*leaf wilt diseases*)、例えばアルテルナリア・ソラニ (*Alternaria solani*) などのアルテルナリア (*Alternaria*) 種; セルコスボラ・ベチコラ (*Cercospora beticola*) などのセルコスボラ (*Cercospora*) 種; クラジオスポリウム・キュキュメリナム (*Cladospodium cucumerinum*) などのクラジオスポリウム (*Cladospodium*) 種; コクリオボラス・サティブス (*Cochliobolus sativus*) (分生子型: ドレクスレラ (*Drechslera*), 同義語: ヘルミントスポリウム (*Helminthosporium*)) などのコクリオボラス (*Cochliobolus*) 種; コレトリカム・リンデムサニウム (*Colletotrichum lindemuthianum*) などのコレトリカム (*Colletotrichum*) 種; シクロコニウム・オレアギナム (*Cycloconium oleaginum*) などのシクロコニウム (*Cycloconium*) 種; ディアポルテ・シトリ (*Diaporthe citri*) などのディアポルテ (*Diaporthe*) 種; エルシノエ・フォーセッティイ (*Elsinoe fawcettii*) などのエルシノエ (*Elsinoe*) 種; グレオスポリウム・ラエティカラー (*Gloeosporium laeticolor*) などのグレオスポリウム種 (*Gloeosporium*); グロメラ・シンギュラータ (*Glomerella cingulata*) などのグロメラ (*Glomerella*) 種; ギニャルディア・ビドウェリ (*Guignardia bidwellii*) などのギニャルディア (*Guignardia*) 種; レプトスファエリア・マキュランズ (*Leptosphaeria maculans*) などのレプトスファエリア (*Leptosphaeria*) 種; マグナポルテ・グリージー (*Magnaporthe grisea*) などのマグナポルテ (*Magnaporthe*) 種; ミ

10

20

30

40

50

クロドチウム・ニバル (*Microdochium nivale*) などのミクロドチウム (*Microdochium*) 種; マイコスファエレラ・グラミニコラ (*Mycosphaerella graminicola*) および *M. fijiensis* などのマイコスファエレラ (*Mycosphaerella*) 種; フェオスファエリア・ノドラム (*Phaeosphaeria nodorum*) などのフェオスファエリア (*Phaeosphaeria*) 種; ピレノフォラ・テレス (*Pyrenophora teres*) などのピレノフォラ (*Pyrenophora*) 種; ラムラリア・コロシグニ (*Ramularia collo-cygni*) などのラムラリア (*Ramularia*) 種; リンコスפורウム・セカリス (*Rhynchosporium secalis*) などのリンコスפורウム (*Rhynchosporium*) 種; セプトリア・アピイ (*Septoria apii*) などのセプトリア (*Septoria*) 種; チフラ・インカルナータ (*Typhula incarnata*) などのチフラ (*Typhula*) 種; ベンチュリア・イナエキュアリス (*Venturia inaequalis*) などのベンチュリア (*Venturia*) 種;

10

以下のものによって引き起こされる根および茎の病害、例えばコルチシウム・グラミネアラム (*Corticium graminearum*) などのコルチシウム (*Corticium*) 種; フサリウム・オキシスポラム (*Fusarium oxysporum*) などのフサリウム (*Fusarium*) 種; ゲウマノミセス・グラミニス (*Gaeumannomyces graminis*) などのゲウマノミセス (*Gaeumannomyces*) 種; リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) などのリゾクトニア (*Rhizoctonia*) 種; タペシア・アキュフォルミス (*Tapesia acuformis*) などのタペシア (*Tapesia*) 種; チエラビオプシス・バシコラ (*Thielaviopsis basicola*) などのチエラビオプシス (*Thielaviopsis*) 種;

20

以下のものによって引き起こされる穂および円錐花序の病害 (トウモロコシ穂軸など)、例えばアルテルナリア属 (*Alternaria* spp.) などのアルテルナリア (*Alternaria*) 種; アスペルギルス・フラバス (*Aspergillus flavus*) などのアスペルギルス (*Aspergillus*) 種; クラドスפורウム・クラドスפורイデス (*Cladosporium cladosporioides*) などのクラドスפורウム (*Cladosporium*) 種; クラビセプス・パープレア (*Claviceps purpurea*) などのクラビセプス (*Claviceps*) 種; フサリウム・クルモラム (*Fusarium culmorum*) などのフサリウム (*Fusarium*) 種; ギッベレラ・ゼアエ (*Gibberella zeae*) などのギッベレラ (*Gibberella*) 種; モノグラフェラ・ニバリス (*Monographella nivalis*) などのモノグラフェラ (*Monographella*) 種; セプトリア・ノドラム (*Septoria nodorum*) などのセプトリア (*Septoria*) 種;

30

以下の黒穂菌 (smut fungi) によって引き起こされる病害、例えばスファセロセカ・ライリアナ (*Sphacelotheca reiliana*) などのスファセロセカ (*Sphacelotheca*) 種; ティレチア・カリエス (*Tilletia caries*)、*T. controversa* などのティレチア (*Tilletia*) 種; ウロシスティス・オキュラータ (*Urocystis occulta*) などのウロシスティス (*Urocystis*) 種; ウスティラゴ・ヌーダ (*Ustilago nuda*)、*U. nuda tritici* などのウスティラゴ (*Ustilago*) 種;

40

以下のものによって引き起こされる果実腐敗、例えばアスペルギルス・フラバス (*Aspergillus flavus*) などのアスペルギルス (*Aspergillus*) 種; ボトリティス・シネレア (*Botrytis cinerea*) などのボトリティス (*Botrytis*) 種; ペニシリウム・エクスパンサム (*Penicillium expansum*) および *P. purpurogenum* などのペ

50

ニシリウム (*Penicillium*) 種; スクレロティニア・スクレロティオラム (*Sclerotinia sclerotiorum*) などのスクレロティニア (*Sclerotinia*) 種; ベルティシリウム・アルボアトラム (*Verticillium albo-atrum*) などのベルティシリウム (*Verticillium*) 種;

以下のものによって引き起こされる種子および土壌伝染性の腐敗病および枯れ病ならびに苗の病害、例えばフサリウム・カルモラム (*Fusarium culmorum*) などのフサリウム (*Fusarium*) 種; フィトフソラ・カクトラム (*Phytophthora cactorum*) などのフィトフソラ (*Phytophthora*) 種; ピチウム・ウルティマム (*Pythium ultimum*) などのピチウム (*Pythium*) 種; リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) などのリゾクトニア (*Rhizoctonia*) 種; スクレロティウム・ロルフシイ (*Sclerotium rolfii*) などのスクレロティウム (*Sclerotium*) 種;

10

以下のものによって引き起こされる癌、こぶ病およびてんぐ巣病、例えばネクトリア・ガリゲナ (*Nectria galligena*) などのネクトリア (*Nectria*) 種;

以下のものによって引き起こされる枯れ病、例えばモニリニア・ラクサ (*Monilinia laxa*) などのモニリニア (*Monilinia*) 種;

以下のものによって引き起こされる葉、花および果実の奇形、例えばタフリナ・デフォルマンズ (*Taphrina deformans*) などのタフリナ (*Taphrina*) 種;

20

以下のものによって引き起こされる木材植物の変性病、例えばファエモニエラ・クラミドスポラ (*Phaemoniella clamydospora*) およびファエオアクレモニウム・アレオフィラム (*Phaeoacremonium aleophilum*) およびフォミチポリタ・メジテラネア (*Fomitiporia mediterranea*) などのエスカ (*Esca*) 種;

以下のものによって引き起こされる花および種子の病害、例えばボトリティス・シネレア (*Botrytis cinerea*) などのボトリティス (*Botrytis*) 種;

以下のものによって引き起こされる植物塊茎の病害、例えばリゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) などのリゾクトニア (*Rhizoctonia*) 種; ヘルミントスポリウム・ソラニ (*Helminthosporium solani*) などのヘルミントスポリウム (*Helminthosporium*) 種;

30

下記のような細菌性病原体によって引き起こされる病害、例えばキサントモナス・キャンペストリス pv. オリザエ (*Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*) などのキサントモナス (*Xanthomonas*) 種; シュードモナス・シリングアエ pv. ラクリマンズ (*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*) などのシュードモナス (*Pseudomonas*) 種; エルウィニア・アミロボラ (*Erwinia amylovora*) などのエルウィニア (*Erwinia*) 種。

【0197】

下記の大豆病害を防除することが好ましい。

40

【0198】

以下のものによって引き起こされる葉、茎、鞘および種子に対する真菌病害、例えばアルテルナリア葉斑点病 (*alternaria leaf spot*) (アルテルナリア属種アトランス・テニュイッシマ (*Alternaria spec. atranstenuissima*))、炭疽病 (コレトトリカム・グロエオスポロイデス・デマティウム亜種トランケイタム (*Colletotrichum gloeosporioides dematium* var. *truncatum*))、褐斑病 (*brown spot*) (セプトリア・グリシネス (*Septoria glycines*))、セルコスポラ葉斑点病 (*cercospora leaf spot*) および焼枯れ病 (*blight*) (セクロスポラ・キクチイ (*Cercospora kikuchii*))、コア

50

ネフォラ葉焼枯れ病 (*choanephora leaf blight*) (コアネフォラ・インファンディブリフェラ・トリスポラ (*Choanephora infundibulifera trispora*) (同義))、ダクチュリオフォラ葉斑点病 (*dactuliophora leaf spot*) (ダクチュリオフォラ・グリシネス (*Dactuliophora glycines*))、べと病 (*downy mildew*) (ペロノスポラ・マンシュリカ (*Peronospora manshurica*))、ドレクスレラ焼枯れ病 (*drechslera blight*) (ドレクスレラ・グリシニ (*Drechslera glycini*))、葉輪紋病 (*frogeye leaf spot*) (セルコスボラ・ソジナ (*Cercospora sojina*))、レプトスファエルリナ葉斑点病 (*leptosphaerulina leaf spot*) (レプトスファエルリナ・トリフォリイ (*Leptosphaerulina trifolii*))、フィロスティカ葉斑点病 (*phyllostica leaf spot*) (フィロスティカ・ソジャエコラ (*Phyllosticta sojaecola*))、鞘および茎の焼枯れ病 (フォモプシス・ソジャエ (*Phomopsis sojae*))、うどんこ病 (*powdery mildew*) (ミクロスファエラ・ディフューザ (*Microsphaera diffusa*))、ピレノチャエタ葉斑点病 (*pyrenochaeta leaf spot*) (ピレノチャエタ・グリシネス (*Pyrenochaeta glycines*))、リゾクトニア・エリアル (*rhizoctonia aerial*)、葉および膜の焼枯れ病 (リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*))、さび病 (ファコプソラ・パチライジ (*Phakopsora pachyrhizi*))、ファコプソラ・メイドミエ (*Phakopsora meiodomiae*))、黒星病 (スファセロマ・グリシネス (*Sphaceloma glycines*))、ステムフィリウム葉焼枯れ病 (*stemphylium leaf blight*) (ステムフィリウム・ボトリオサム (*Stemphylium botryosum*))、輪紋病 (コリネスボラ・カッシイコラ (*Corynespora cassiicola*))。

【0199】

下記のものによって引き起こされる根および茎基部の真菌病、例えば黒根腐病 (*black root rot*) (カロネクトリア・クロタラリアエ (*Calonectria crotalariae*))、炭腐病 (マクロフォミナ・ファセオリナ (*Macrophomina phaseolina*))、フザリウム焼枯病 (*fusarium blight*) または萎凋病 (*wilt*)、根腐れ病ならびに鞘および頸部腐れ病 (*rot*) (フザリウム・オキシスポラム (*Fusarium oxysporum*))、フザリウム・オルトセラス (*Fusarium orthoceras*)、フザリウム・セミテクタム (*Fusarium semitectum*)、フザリウム・エキイセチ (*Fusarium equiseti*)、マイコレプトディスカス根腐れ病 (*mycoleptodiscus root rot*) (マイコレプトディスカス・テレストリス (*Mycoleptodiscus terrestris*))、ネオコスモスポラ (*neocosmospora*) (ネオコスモスポラ・バスインフェクタ (*Neocosmopspora vasinfecta*))、鞘および茎の焼枯病 (*blight*) (ディアポルセ・ファセオロラム (*Diaporthe phaseolorum*))、枝枯れ病 (ディアポルセ・ファセオロラム亜種カウリボラ (*Diaporthe phaseolorum var. caulivora*))、フィトフトラ腐れ病 (*phytophthora rot*) (フィトフトラ・メガスペルマ (*Phytophthora megasperma*))、褐色茎腐れ病 (*brown stem rot*) (フィアロフォラ・グレガータ (*Phialophora gregata*))、ピチウム腐れ病 (*pythium rot*) (ピチウム・アフアニデルマタム (*Pythium aphanidermatum*))、ピチウム・イレギュラーレ (*Pythium irregulare*)、ピチウム・デバリアナム (*Pythium debaryanum*)、ピチウム・ミリオチラム (*Pythium myriotylum*)、ピチウム・ウルティマム (*Pythiu*

10

20

30

40

50

m ultimum))、リゾクトニア根腐れ病 (rhizoctonia root rot)、茎腐敗および立枯病 (リゾクトニア・ソラニ (Rhizoctonia solani))、スクレロティニア茎腐敗病 (sclerotinia stem decay) (スクレロティニア・スクレロティオラム (Sclerotinia sclerotiorum))、スクレロティニア白絹病 (sclerotinia Southern blight) (スクレロティニア・ロルフシイ (Sclerotinia rolfsii))、チエラビオプシス根腐れ病 (thielaviopsis root rot) (チエラビオプシス・バシコラ (Thielaviopsis basicola))。

【0200】

工業材料の劣化または変化を生じさせ得る生物には、例えば細菌、真菌、酵母、藻類および粘液生物などがある。本発明の有効成分は好ましくは、真菌、特にかび、木材を変色させるおよび木材を分解する真菌 (担子菌類) に対して、そして粘液生物および藻類に対して作用する。例としては下記の属の微生物などがある。すなわちアルタナリア・テヌイス (Alternaria tenuis) などのアルタナリア (Alternaria) ; アスペルギルス・ニガー (Aspergillus niger) などのアスペルギルス (Aspergillus) ; ケトミウム・グロボーサム (Chaetomium globosum) などのケトミウム (Chaetomium) ; コニオホーラ・プエタナ (Coniophora puetana) などのコニオホーラ (Coniophora) ; レンティナス・チグリヌス (Lentinus tigrinus) などのレンティナス (Lentinus) ; ペニシリウム・グラウカム (Penicillium glaucum) などのペニシリウム (Penicillium) ; ポリポルス・バージカラー (Polyporus versicolor) などのポリポルス (Polyporus) ; アウレオバシジウム・プルランス (Aureobasidium pullulans) などのアウレオバシジウム (Aureobasidium) ; スクレロフォーマ・ピティオフィラ (Sclerophoma pityophila) などのスクレロフォーマ (Sclerophoma) ; トリコデルマ・ヴィリデ (Trichoderma viride) などのトリコデルマ (Trichoderma) ; 大腸菌などのエシェリキア属 (Escherichia) ; 緑膿菌などのシュードモナス属 (Pseudomonas) ; 黄色ブドウ球菌などのブドウ球菌 (Staphylococcus) である。

【0201】

さらに、本発明の有効成分は、非常に良好な抗カビ活性も有する。その化合物は、特に皮膚糸状菌および酵母、カビおよび二相性真菌 (例えば、カンジダ・アルビカンス (Candida albicans)、カンジダ・グラブラタ (Candida glabrata) などのカンジダ種) およびエピデルモフィトン・フロッコズム (Epidermophyton floccosum)、アスペルギルス・ニガー (Aspergillus niger) およびアスペルギルス・フミガタス (Aspergillus fumigatus) などのアスペルギルス (Aspergillus) 種、トリコフィトン・メンタグロフィテス (Trichophyton mentagrophytes) などのトリコフィトン (Trichophyton) 種、マイクロスポロン・カニス (Microsporon canis) およびオードイニイ (audouinii) などの小孢子菌属 (Microsporon) 種において非常に広い抗カビ活性スペクトルを有する。この真菌の列記は、網羅される真菌スペクトルを全く限定することなく、説明のみを意図したものである。

【0202】

従って本発明の有効成分は、医薬分野および非医薬分野の両方で用いることができる。

【0203】

本発明の有効成分を殺菌剤として用いる場合、施用量は、施用の種類に応じて比較的広い範囲内で変動し得るものである。本発明の有効成分の施用量は、

・植物部分、例えば葉の処理の場合、0.1から10000g/ha、好ましくは10から1000g/ha、特に好ましくは50から300g/ha（施用を灌水または滴下によって行う場合、特に岩綿または真珠岩などの不活性物質を用いる場合に施用量を減らすことも可能である。）；

・種子処理の場合、2から200g/種子100kg、好ましくは3から150g/種子100kg、より好ましくは2.5から25g/種子100kg、さらにより好ましくは2.5から12.5g/種子100kg；

・土壌処理の場合、0.1から10000g/ha、好ましくは1から5000g/haである。

【0204】

これらの施用量は、例示としてのみのものであって、本発明に関しては限定的ではない。

【0205】

従って本発明の有効成分または組成物は、処理してから一定期間にわたり言及した病原体による攻撃から植物を保護するのに用いることができる。保護を提供する期間は、通常は有効成分で植物を処理してから1から28日間、好ましくは1から14日間、より好ましくは1から10日間、最も好ましくは1から7日間、または種子処理から200日以内にわたる。

【0206】

さらに、本発明の処理によって、収穫物および食品およびそれから製造される飼料中のマイコトキシン含有量を減らすことが可能である。マイコトキシン類には、特に下記のものなどがあるが、これらに限定されるものではない。すなわち次の真菌：フザリウム・アクミナツム (*Fusarium acuminatum*)、フザリウム・アベナセウム (*F. avenaceum*)、フザリウム・クロオクウェレンセ (*F. crookwellense*)、フザリウム・クルモルム (*F. culmorum*)、フザリウム・グラミネアルム (*F. graminearum*)（ジベレラ・ゼアエ (*Gibberella zeae*)）、フザリウム・エクイセチ (*F. equiseti*)、フザリウム・フジコロイ (*F. fujikoroii*)、フザリウム・ムサルム (*F. musarum*)、フザリウム・オキシスポルム (*F. oxysporum*)、フザリウム・プロリフェラツム (*F. proliferatum*)、フザリウム・ポアエ (*F. poae*)、フザリウム・シュードグラミネアルム (*F. pseudograminearum*)、フザリウム・サムブシヌム (*F. sambucinum*)、フザリウム・シルピ (*F. scirpi*)、フザリウム・セミテクトム (*F. semitectum*)、フザリウム・ソラニ (*F. solani*)、フザリウム・スポロトリコイデス (*F. sporotrichoides*)、フザリウム・ラングセチアエ (*F. langsethiae*)、フザリウム・セブグルチナンス (*F. subglutinans*)、フザリウム・トリシンクツム (*F. tricinctum*)、フザリウム・ベルチシリオイデス (*F. verticillioides*) などのフザリウム (*Fusarium*) 種などによって、さらに特にはアスペルギルス (*Aspergillus*) 種、ペニシリウム (*Penicillium*) 種、クラビセプス・プルプレア (*Claviceps purpurea*)、スタキボトリス (*Stachybotrys*) 種によって産生され得るデオキシニバレノール (DON)、ニバレノール、15-Ac-DON、3-Ac-DON、T2-およびHT2-毒素、フモニシン類、ゼアラレノン、モニリホルニン、フザリン、ジアセトキシシルペノール (DAS)、ボーベリシン、エンニアチン、フザロプロリフェリン、フザレノール、オクラトキシン類、パツリン、麦角アルカロイド類およびアフラトキシン類である。

【0207】

場合により、本発明の化合物は、特定の濃度または施用量で、除草剤、薬害軽減剤、成長調節剤もしくは植物特性を改善する薬剤として、または殺微生物剤、例えば、殺真菌剤、抗真菌剤、殺細菌剤、殺ウイルス剤（ウイロイドに対する組成物など）としてまたはM

10

20

30

40

50

L O（マイコプラズマ様微生物）およびR L O（リケッチア（*R i c k e t t s i a*）様微生物）に対する組成物として使用することもできる。適切な場合、それらは、他の有効成分の合成における中間体または前駆体として用いることもできる。

【0208】

本発明の有効成分は、植物の代謝に介入することから、成長調節剤として使用することも可能である。

【0209】

植物成長調節剤は、植物に対して各種効果をもたらす得る。それらの物質の効果は実質的に、植物の発達段階に関係する施用時点、ならびに植物もしくはその環境に施用される有効成分の量、ならびに施用の様式によって決まる。各場合で、成長調節剤作物に対して

10

【0210】

植物成長調節化合物は、例えば植物の栄養成長を阻害するのに用いることができる。そのような成長阻害は、観賞用庭園、公園およびスポーツ施設での、道路沿いでの、空港または果菜類での草刈りの回数を減らすことが可能であることから、例えば草の場合に経済的利益のあるものである。道路沿いおよびパイプラインもしくは高架線近傍での、または全く一般的に活発な植物成長が望ましくない区域での草本植物および木本植物の成長を阻害することも重要である。

【0211】

やはり重要な点として、穀物の縦成長の阻害における成長調節剤の使用がある。これによって、収穫前の植物の倒伏のリスクが低減または完全になくなる。さらに、穀物の場合の成長調節剤は、やはり倒伏に対抗する茎を強化することができる。茎の短縮および強化のための成長調節剤の使用によって、穀物の倒伏リスクなしに、より多くの肥料を用いて収量を高めることができる。

20

【0212】

多くの作物植物で、栄養成長の阻害によって、より高密度の植え付けが可能となることから、土壌表面基準でより高い収量を達成することが可能である。このようにして得られる相対的に小さい植物の別の利点は、作物の栽培および収穫が容易になるという点である。

【0213】

栄養植物成長を阻害することによって、養分および同化産物が、植物の成長部分と比較して花および果実形成に対してより有用であることから収量も高めることができる。

30

【0214】

非常に多くの場合、成長調節剤を用いて栄養成長を促進することもできる。これは、成長植物部分を収穫する場合には非常に有用である。しかしながら栄養成長を促進することで、より多くの同化産物が形成されて、結果的により多くの果実またはより大きい果実が得られるという点で生殖成長も促進され得る。

【0215】

場合により、栄養成長に検出可能な変化を生じることなく、植物の代謝を操作することで、収量増加を達成することができる。さらに、成長調節剤を用いて植物の組成を変えることができ、それによって収穫物の品質向上を達成することができる。例えば、サトウダイコン、サトウキビ、パイナップルおよび柑橘果実における糖分含有率を高めるか、大豆または穀物におけるタンパク質含有量を高めることができる。例えば、成長調節剤を用いて、収穫前もしくは収穫後に、所望の成分、例えばサトウダイコンまたはサトウキビにおける糖分の分解を抑制することもできる。二次植物成分の産生または除去に良好な影響を与えることも可能である。1例は、ゴムノキにおけるラテックスの流れの刺激である。

40

【0216】

成長調節剤の影響下に、単為結実果実を形成することができる。さらに、花の性別に影響を与えることが可能である。雑種種子の育種および生産において非常に重要である不稔花粉を製造することもできる。

50

【0217】

成長調節剤を用いることで、植物の枝分かれを制御することができる。一方、頂芽優性を破壊することで、成長抑制とも組み合わせて、特に観賞植物の栽培で非常に望ましい場合がある横芽の発達を促進することができる。しかしながら他方、横芽の成長を抑制することも可能である。この効果は、例えばタバコの栽培またはトマトの栽培において特に興味深いものである。

【0218】

成長調節剤の影響下に、植物における葉の量を制御して、植物の落葉を所望の時点で行うようにすることができる。そのような落葉は、綿の機械収穫で主要な役割を果たすが、他の作物、例えばブドウ栽培での収穫を容易にする上でも興味深いものである。植物の落葉は、移植する前に植物の蒸散を低下させるのに行うこともできる。

10

【0219】

成長調節剤は同様に、果実の裂開を調節するのに用いることができる。一方で、早期の果実裂開を防止することができる。他方、果実の裂開または花の不結実を促進して、所望の量を得て（「間引き」）、交互性をなくすこともできる。交互性とは、内因的な理由により一部の果実種の特徴を意味し、年ごとに非常に異なる収量をもたらすことを意味するものと理解される。最後に、収穫の時点で成長調節剤を用いて、果実を切り離すのに要する力を低減することで、機械による収穫を可能としたり、手作業での収穫を楽にすることが可能である。

【0220】

20

成長調節剤を用いて、収穫前または収穫後に収穫物の成熟を早めたり遅らせたりすることもできる。それによって市場の需要量に対する至適な調節が可能となることから、それは特に有利である。さらに、成長調節剤は場合により、果実の色を改善することができる。さらに、成長調節剤を用いて、ある一定期間内に成熟を集中させることもできる。これによって、例えばタバコ、トマトまたはコーヒーの場合に、単一の操作で完全機械収穫または手作業での収穫のための必要条件が確立される。

【0221】

成長調節剤を用いることで、植物の種子または芽の休眠に影響を与えることで、苗床でのパイナップルまたは観賞植物などの植物が例えば、通常では起こらない時点で発芽、発生または開花するようにすることが可能である。霜のリスクがある区域では、成長調節剤の助けを借りて種子の発芽や発生を遅延させることによって、遅霜によって生じる損害を回避することが望ましい場合がある。

30

【0222】

最後に、成長調節剤は、霜、乾燥または土壌の高塩分に対する植物の耐性を誘発することができる。これによって、栽培には通常適さない地域での植物の栽培が可能となる。

【0223】

列記した植物は、特に有利には、本発明に従って、一般式（I）の化合物および本発明の組成物で処理することができる。有効成分または組成物について上記で述べた好ましい範囲は、これら植物の処理にも適用されるものである。特に強調されるべきものは、本記述で具体的に言及されている化合物または組成物による植物の処理である。

40

【0224】

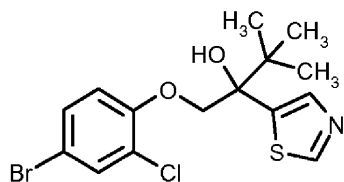
本発明は、下記の実施例によって説明される。しかしながら、本発明はその実施例に限定されるものではない。

【0225】

製造例化合物番号2の製造（方法C）

【0226】

【化 9】



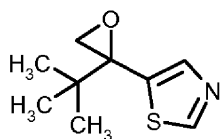
N, N-ジメチルホルムアミド 10 mL に溶かした 4-ブromo-2-クロロフェノール 0.62 g (3.0 mmol) に、室温でアルゴン雰囲気下に水素化ナトリウム 0.12 g (60%, 3.0 mmol) を加え、反応混合物を室温で 1 時間攪拌した。次に、5-(2-tert-butylthiazol-2-yl)-1, 3-チアゾール 0.50 g (2.7 mmol) を加え、反応混合物を 100 °C で 12 時間攪拌した。冷却して室温とした後、溶媒を減圧下に除去し、飽和塩化ナトリウム水溶液および酢酸エチルを残留物に加えた。有機相を除去し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、濃縮した。粗生成物をカラムクロマトグラフィー (3 : 1 シクロヘキサン / 酢酸エチル) によって精製した。これによって、所望の生成物 0.24 g (23%) が得られた。

【0227】

5-(2-tert-butylthiazol-2-yl)-1, 3-チアゾールの製造

【0228】

【化 10】



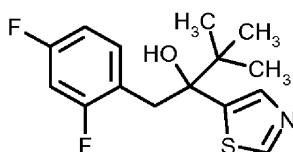
EP-A 0409418 に記載の方法と同様にして製造を行う。

【0229】

化合物 No. 31 の製造 (方法 A)

【0230】

【化 11】



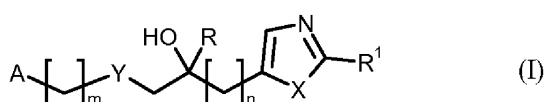
ジエチルエーテル 10 mL に溶かした 2, 2-ジメチル-1-(1, 3-チアゾール-5-yl)プロパン-1-オン 0.30 g (1.8 mmol) に、-10 °C でアルゴン雰囲気下に、2, 4-ジフルオロベンジルマグネシウムブロマイド 21 mL (0.25 M ジエチルエーテル中溶液、5.3 mmol) を加え、反応混合物を昇温させて室温とした。反応混合物を室温で 12 時間攪拌した。飽和塩化アンモニウム水溶液を加えた後、相を分離し、水相を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過し、濃縮した。粗生成物をカラムクロマトグラフィー (5 : 1 シクロヘキサン / 酢酸エチル) によって精製した。これによって、所望の生成物 0.20 g (39%) が得られた。

【0231】

表 1

【0232】

【化 12】



(I)

10

20

30

40

50

【0233】

【表1】

番号	X	Y	m	n	R	R ¹	A	物理データ
1	S	O	0	0	t B u	H	2-フルオロ-4-ヨードフェニル	¹ H NMR: δ (400MHz, DMSO-d ₆) = 0.98 (s, 9H)、4.25 (d, J=10Hz, 1H)、4.40 (d, J=10Hz, 1H)、5.75 (s, 1H)、7.07 (m, 1H)、7.47 (m, 1H)、7.57 (m, 1H)、7.76 (s, 1H)、8.93 (s, 1H) ppm.
2	S	O	0	0	t B u	H	4-ブロモ-2-クロロフェニル	¹ H NMR: δ (400MHz, DMSO-d ₆) = 0.97 (s, 9H)、4.25 (d, J=10Hz, 1H)、4.38 (d, J=10Hz, 1H)、5.69 (s, 1H)、7.17 (d, J=9Hz, 1H)、7.48 (dd, J=9Hz, 2Hz, 1H)、7.63 (d, J=2Hz, 1H)、7.81 (s, 1H)、8.92 (s, 1H) ppm.
3	S	O	0	0	t B u	H	4-ブロモ-2-フルオロフェニル	¹ H NMR: δ (400MHz, DMSO-d ₆) = 0.98 (s, 9H)、4.26 (d, J=10Hz, 1H)、4.41 (d, J=10Hz, 1H)、5.73 (s, 1H)、7.22 (m, 1H)、7.31 (m, 1H)、7.47 (m, 1H)、7.76 (s, 1H)、8.92 (s, 1H) ppm.
4	S	O	0	0	t B u	H	4-クロロ-2-(メチルスルファニル)フェニル	¹ H NMR: δ (400MHz, DMSO-d ₆) = 1.00 (s, 9H)、2.34 (s, 3H)、4.18 (d, J=10Hz, 1H)、4.37 (d, J=10Hz, 1H)、5.60 (s, 1H)、7.01 (d, J=2Hz, 1H)、7.08 (m, 1H)、7.14 (m, 1H)、7.86 (s, 1H)、8.92 (s, 1H) ppm.
5	S	O	0	0	t B u	H	2-クロロ-4-ヨードフェニル	log P 4.14 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 438.
6	S	O	0	0	i P r	H	4-ブロモ-2-フルオロフェニル	¹ H NMR: δ (400MHz, DMSO-d ₆) = 0.81 (d, 3H)、0.90 (d, 3H)、2.27 (7重線, 1H)、4.15 (d, 1H)、4.22 (d, 1H)、5.80 (s, 1H)、7.18 (t, 1H)、7.29-7.35 (m, 1H)、7.51 (dd, 1H)、7.78 (s, 1H)、8.95 (s, 1H) ppm;
7	S	O	0	0	M C P	H	3, 5-ジブロモフェニル	log P 4.03 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 434
8	S	O	0	0	i P r	H	4-ブロモ-2-クロロフェニル	¹ H NMR: δ (400MHz, DMSO-d ₆) = 0.81 (d, 3H)、0.91 (d, 3H)、2.36 (7重線, 1H)、4.13 (d, 1H)、4.19 (d, 1H)、5.80 (s, 1H)、7.13 (d, 1H)、7.47 (dd, 1H)、7.66 (d, 1H)、7.82 (s, 1H)、8.94 (s, 1H) ppm;
9	S	O	0	0	i P r	H	4-クロロ-2-(メチルスルファニル)フェニル	¹ H NMR: δ (400MHz, DMSO-d ₆) = 0.80 (d, 3H)、0.91 (d, 3H)、2.38 (7重線, 1H)、2.41 (s, 3H)、4.05 (d, 1H)、4.13 (d, 1H)、5.75 (s, 1H)、6.94 (d, 1H)、7.08-7.13 (m, 2H)、7.85 (s, 1H)、8.93 (s, 1H) ppm;
10	S	O	0	0	M C P	H	4-ヨード-2-メチルフェニル	log P 3.88 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 416

10

20

30

番号	X	Y	m	n	R	R ¹	A	物理データ
11	S	O	0	0	MCP	H	4-ブロモ-3-クロロフェニル	¹ H NMR: δ (400MHz, DMSO-d ₆) = 0.1-0.18 (m, 1H)、0.28-0.38 (m, 1H)、0.85-0.95 (m, 1H)、0.95 (s, 3H)、0.95-1.03 (m, 1H)、4.28 (d, 1H)、4.49 (d, 1H)、5.70 (s, 1H)、6.96 (dd, 1H)、7.35 (d, 1H)、7.64 (d, 1H)、7.85 (s, 1H)、8.98 (s, 1H) ppm
12	S	O	0	0	MCP	H	4-ブロモ-3-フルオロフェニル	log P 3.30 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 372、374
13	S	O	0	0	MCP	H	4-ブロモ-3-(トリフルオロメチル)フェニル	log P 3.70 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 422、424
14	S	O	0	0	tBu	H	2-メトキシ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル	log P 3.70 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 392.
15	S	O	0	0	MCP	H	4-ヨード-3-ニトロフェニル	log P 3.11 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 447
16	S	O	0	0	tBu	H	3-フルオロ-4-[(トリフルオロメチル)スルファニル]フェニル	log P 3.96 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 396.
17	S	O	0	0	tBu	H	3-メチル-4-(メチルスルホニル)フェニル	log P 2.21 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 370.
18	S	O	0	0	tBu	H	3-メチル-4-(メチルスルフィニル)フェニル	log P 1.90 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 354.
19	S	O	0	0	tBu	H	2-メチル-4-[(トリフルオロメチル)スルホニル]フェニル	log P 3.63 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 424.
20	S	O	0	0	tBu	H	2-メトキシ-4-[(トリフルオロメチル)スルホニル]フェニル	log P 3.37 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 440.
21	S	O	0	0	tBu	H	3-クロロ-4-[(トリフルオロメチル)スルファニル]フェニル	log P 4.31 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 412.
22	S	O	0	0	tBu	H	3-メチル-4-[(トリフルオロメチル)スルファニル]フェニル	log P 4.35 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 392.
23	S	O	0	0	tBu	H	2-メチル-4-[(トリフルオロメチル)スルファニル]フェニル	log P 4.43 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 392.
24	S	O	0	0	tBu	H	3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル	log P 4.02 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 396.
25	S	O	0	0	tBu	H	4-クロロ-2-メチルフェニル	log P 3.77 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 326.
26	S	O	0	0	tBu	H	4-クロロ-2-フルオロフェニル	log P 3.37 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 330.
27	S	O	0	0	tBu	H	4-クロロ-3-メチルフェニル	log P 3.74 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 326.
28	S	O	0	0	tBu	H	3-メチル-4-(メチルスルファニル)フェニル	log P 3.63 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 338
29	S	O	0	0	tBu	H	2-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル	log P 4.10 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 396

10

20

30

番号	X	Y	m	n	R	R ¹	A	物理データ
30	S	O	0	0	t Bu	H	3-クロロロビフェニル-4-イル	¹ H NMR: δ (400MHz, DMSO-d ₆) = 1.04 (s, 9H)、4.29 (d, J=10Hz, 1H)、4.43 (d, J=10Hz, 1H)、5.73 (s, 1H)、7.27 (d, J=9Hz, 1H)、7.34 (m, 1H)、7.44 (m, 2H)、7.61 (m, 3H)、7.71 (d, J=2Hz, 1H)、7.87 (s, 1H)、8.94 (s, 1H) ppm.
31	S	—	0	0	t Bu	H	2, 4-ジフルオロフェニル	log P 3.04 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 298.
32	S	O	0	0	MCP	H	4-ブロモ-2-フルオロフェニル	log P 3.32 ^[a] ; [M+H] ⁺ = 372, 374
33	S	O	0	0	t Bu	H	2, 4-ジクロロフェニル	log P 3.84 ^[a]
34	S	O	0	0	t Bu	H	2, 4-ジフルオロフェニル	log P 2.98 ^[a]
35	S	O	0	0	MCP	H	4-ブロモ-2-メトキシフェニル	log P 3.26 ^[a]
36	S	O	0	0	MCP	H	4-ブロモ-3-メトキシフェニル	log P 3.16 ^[a]
37	S	O	0	0	t Bu	H	4-クロロ-2-(トリフルオロメチル)フェニル	log P 3.96 ^[a]
38	S	O	0	0	TFCP	H	2-フルオロ-4-ヨードフェニル	
39	S	O	0	0	t Bu	H	3, 4-ジクロロフェニル	log P 3.72 ^[a]
40	S	O	0	0	TFCP	H	4-ブロモ-2-メチルフェニル	
41	S	O	0	0	t Bu	H	3-ブロモ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル	log P 4.12 ^[a]
42	S	O	0	0	t Bu	H	2-メチル-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル	log P 4.12 ^[a]
43	S	—	0	1	CCP	Cl	2, 4-ジクロロフェニル	

i Pr = イソプロピル、t Bu = tert-ブチル、DFMP = 1, 3-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル、CCP = 1-クロロシクロプロピル、FCP = 1-フルオロシクロプロピル、MCP = 1-メチルシクロプロピル、TFCP = 1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル、CCP = 1-クロロシクロプロピル。

【0234】

log P 値は、下記の方法により、逆相カラム (C18) を用いる HPLC (高速液体クロマトグラフィー) によって、EEC 通達 79/831 補遺 V. A8 に従って測定した。

【0235】

[a] 酸性範囲での LC-MS 測定は、溶離液として 0.1% ギ酸水溶液およびアセトニトリル (0.1% ギ酸を含む) ; 10% アセトニトリルから 95% アセトニトリルの直線勾配を用いて pH 2.7 で行う。

【0236】

[b] 酸性範囲での LC-MS 測定は、溶離液として 0.1% リン酸水溶液およびアセトニトリル (0.1% リン酸を含む) ; 10% アセトニトリルから 95% アセトニトリルの直線勾配を用いて pH 2.3 で行う。

【0237】

特定実施例のさらなる NMR データ

下記の特実実施例の ¹H NMR データは、¹H NMR ピークリストの形で示してある。各シグナルピークについて、最初に ppm 単位での δ 値と次に括弧内にシグナル強度を列記してあり、それらはスペースで隔てている。異なるシグナルピークの δ -シグナル強度値のペアは、セミコロンによって互いに隔てて列記してある。従って、1例のピークリストは、次の形となる。

【0238】

δ_1 (強度₁) ; δ_2 (強度₂) ; ; δ_i (強度_i) ; ; δ_n (強度_n)

NMR スペクトラムを記録した溶媒を、実施例番号の後で NMR ピークリストの前に列記してある。ピークリストの形での NMR データの表示についての詳細な説明は、刊行物

10

20

30

40

50

「特許出願内のNMRピークリストデータの引用 (Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications) (Research Disclosure Database Number 564025、2011、2011年3月16日または<http://www.rdelectronic.co.uk/rd/free/RD564025.pdf>参照) に記載されている。

【0239】

【表2】

実施例33 [DMSO-d ₆] 8.9252 (1.70) ; 7.8174 (1.99) ; 7.5363 (1.28) ; 7.5299 (1.35) ; 7.3763 (0.66) ; 7.3698 (0.61) ; 7.3541 (0.91) ; 7.3476 (0.85) ; 7.2447 (1.41) ; 7.2224 (1.01) ; 5.7075 (2.38) ; 4.4053 (0.78) ; 4.3804 (1.08) ; 4.2752 (1.06) ; 4.2503 (0.77) ; 3.3076 (15.73) ; 2.5109 (2.04) ; 2.5066 (3.68) ; 2.5022 (4.70) ; 2.4978 (3.29) ; 2.4935 (1.59) ; 1.0097 (16.00) ; 0.9766 (0.32) ; -0.0002 (0.55)	10
実施例34 [DMSO-d ₆] 8.9306 (1.68) ; 7.7749 (1.98) ; 7.7738 (1.88) ; 7.2648 (0.56) ; 7.2549 (0.60) ; 7.2413 (0.68) ; 7.2360 (0.69) ; 7.2296 (0.52) ; 7.2170 (0.39) ; 7.2146 (0.39) ; 7.2067 (0.32) ; 6.9955 (0.36) ; 6.9931 (0.39) ; 5.7292 (2.49) ; 4.4182 (0.81) ; 4.3934 (1.05) ; 4.2526 (1.04) ; 4.2278 (0.80) ; 3.3064 (20.14) ; 2.5101 (2.51) ; 2.5059 (4.55) ; 2.5014 (5.86) ; 2.4971 (4.15) ; 2.4928 (2.04) ; 2.0856 (0.98) ; 0.9834 (16.00)	20
実施例35 [DMSO-d ₆] 8.8319 (0.91) ; 8.8306 (0.83) ; 7.7553 (1.08) ; 7.7539 (0.98) ; 7.0090 (0.61) ; 7.0042 (0.65) ; 6.9249 (0.70) ; 6.9199 (0.72) ; 6.9139 (1.00) ; 5.4730 (0.53) ; 4.2354 (0.44) ; 4.2106 (0.56) ; 4.0778 (0.55) ; 4.0530 (0.43) ; 3.6439 (3.78) ; 3.1747 (16.00) ; 2.3756 (1.80) ; 2.3714 (3.19) ; 2.3669 (4.02) ; 2.3626 (2.79) ; 2.3583 (1.34) ; 1.2644 (2.79) ; 0.8283 (2.72)	30
実施例38 [DMSO-d ₆] 9.0525 (1.82) ; 9.0512 (1.78) ; 7.9899 (1.92) ; 7.6233 (0.67) ; 7.6182 (0.70) ; 7.5966 (0.67) ; 7.5915 (0.71) ; 7.5079 (0.42) ; 7.5043 (0.52) ; 7.4865 (0.48) ; 7.4828 (0.58) ; 7.4782 (0.42) ; 7.1953 (0.57) ; 7.1732 (1.01) ; 7.1511 (0.51) ; 6.4388 (2.18) ; 4.5935 (0.42) ; 4.5	40

6 7 5 (1. 0 5) ; 4. 5 4 0 6 (0. 9 9) ; 4. 5 1 4 5 (0. 3 7) ; 3. 3 0 3 4 (1 6 1. 7 1) ; 2. 8 9 0 2 (0. 4 0) ; 2. 7 3 0 7 (0. 3 4) ; 2. 6 6 9 0 (0. 3 4) ; 2. 5 3 9 1 (0. 8 2) ; 2. 5 0 8 8 (1 9. 0 0) ; 2. 5 0 4 4 (3 4. 2 9) ; 2. 5 0 0 0 (4 3. 9 6) ; 2. 4 9 5 6 (3 0. 4 1) ; 2. 4 9 1 2 (1 4. 6 7) ; 1. 9 8 6 7 (0. 6 4) ; 1. 4 3 4 5 (0. 3 6) ; 1. 3 9 8 4 (1 6. 0 0) ; 1. 1 7 4 9 (0. 4 1) ; 1. 0 3 4 3 (0. 4 0) ; 1. 0 2 1 5 (0. 3 6) ; 1. 0 1 7 6 (0. 3 6) ; 0. 9 0 7 2 (0. 3 5) ; 0. 9 0 2 3 (0. 3 5) ; 0. 8 9 4 1 (0. 3 3) ; 0. 8 9 0 1 (0. 4 0) ; -0. 0 0 0 2 (2. 9 8)	10
実施例 3 9 [DMSO-d ₆] 8. 9 2 9 3 (1. 6 6) ; 8. 9 2 5 2 (1. 5 0) ; 7. 7 4 9 9 (2. 0 1) ; 7. 7 4 6 0 (1. 8 1) ; 7. 4 9 6 8 (1. 0 6) ; 7. 4 9 1 2 (1. 0 4) ; 7. 4 7 4 5 (1. 1 4) ; 7. 4 6 8 9 (1. 0 9) ; 7. 2 9 3 6 (1. 1 9) ; 7. 2 8 7 8 (1. 7 3) ; 7. 2 8 1 2 (1. 1 0) ; 6. 9 6 2 5 (0. 6 7) ; 6. 9 5 6 7 (0. 9 5) ; 6. 9 4 9 8 (0. 6 3) ; 6. 9 4 0 2 (0. 6 4) ; 6. 9 3 4 3 (0. 8 7) ; 6. 9 2 7 4 (0. 5 4) ; 5. 7 4 7 8 (2. 1 8) ; 5. 7 4 2 3 (2. 1 0) ; 4. 4 8 5 5 (0. 8 5) ; 4. 4 8 1 1 (0. 7 9) ; 4. 4 6 0 6 (1. 0 2) ; 4. 4 5 6 3 (0. 9 2) ; 4. 2 2 6 0 (1. 0 0) ; 4. 2 2 1 6 (0. 9 3) ; 4. 2 0 1 2 (0. 8 6) ; 4. 1 9 6 6 (0. 7 8) ; 3. 3 1 7 6 (2 3. 0 7) ; 3. 3 1 2 1 (2 3. 1 9) ; 2. 5 0 7 0 (8. 0 1) ; 2. 5 0 2 8 (7. 2 5) ; 1. 4 0 3 2 (6. 8 6) ; 1. 3 9 7 7 (6. 6 3) ; 0. 9 8 1 5 (1 6. 0 0) ; 0. 9 7 6 7 (1 5. 1 0) ; 0. 0 0 5 6 (0. 3 3) ; -0. 0 0 0 2 (0. 3 4)	20
実施例 4 0 [DMSO-d ₆] 9. 0 5 0 8 (0. 6 7) ; 8. 0 1 1 0 (0. 7 1) ; 7. 3 4 1 4 (0. 7 7) ; 7. 3 2 2 3 (0. 3 5) ; 6. 3 7 2 8 (0. 8 6) ; 5. 7 4 6 1 (1 6. 0 0) ; 3. 4 2 7 6 (0. 3 8) ; 3. 3 1 0 3 (8 7 8. 8 5) ; 3. 2 8 7 4 (8. 3 8) ; 3. 1 7 9 2 (0. 4 1) ; 2. 6 7 3 8 (0. 7 9) ; 2. 6 6 9 4 (1. 0 6) ; 2. 6 6 5 0 (0. 8 2) ; 2. 5 3 9 3 (2. 2 7) ; 2. 5 0 9 0 (5 7. 9 8) ; 2. 5 0 4 8 (1 0 3. 5 1) ; 2. 5 0 0 4 (1 3 1. 5 4) ; 2. 4 9 6 0 (9 2. 0 7) ; 2. 4 9 1 8 (4 4. 8 8) ; 2. 3 3 1 5 (0. 7 1) ; 2. 3 2 7 0 (0. 9 1) ; 2. 3 2 2 3 (0. 6 5) ; 2. 1 4 8 9 (1. 8 9) ; -0. 0 0 0 2 (2 0. 2 1) ; -0. 0 0 8 4 (0. 6 7)	30
実施例 4 1 [DMSO-d ₆] 8. 9 3 4 6 (1. 0 9) ; 7. 7 5 6 4 (1. 5 0) ; 7. 4 3 7 6 (1. 4 3) ; 7. 4 3 0 2 (1. 6 5) ; 7. 4	40

2 6 7 (0. 7 4) ; 7. 4 2 3 3 (0. 6 8) ; 7. 4 0 3 7 (0. 6 7) ; 7. 4 0 0 6 (0. 6 8) ; 7. 0 4 8 7 (0. 8 0) ; 7. 0 4 1 3 (0. 7 7) ; 7. 0 2 6 0 (0. 7 2) ; 7. 0 1 8 5 (0. 7 1) ; 5. 7 6 6 5 (1. 4 1) ; 4. 5 1 2 4 (0. 8 3) ; 4. 4 8 7 5 (0. 9 8) ; 4. 2 3 6 7 (0. 9 6) ; 4. 2 1 1 7 (0. 8 4) ; 3. 3 2 8 7 (8. 4 5) ; 2. 5 1 0 6 (4. 2 8) ; 2. 5 0 6 5 (8. 3 1) ; 2. 5 0 2 2 (11. 5 4) ; 2. 4 9 8 0 (8. 0 3) ; 2. 4 9 3 8 (4. 0 3) ; 0. 9 7 6 7 (16. 0 0) ; -0. 0 0 0 2 (3. 3 4)	
实施例 4 2 [DMSO-d ₆] 8. 9 2 8 9 (1. 6 3) ; 7. 7 4 1 8 (1. 6 7) ; 7. 1 3 5 1 (0. 3 9) ; 7. 1 1 3 0 (1. 5 9) ; 7. 0 8 0 6 (1. 1 5) ; 7. 0 5 9 8 (0. 6 2) ; 5. 7 0 4 3 (2. 4 3) ; 4. 3 3 6 1 (0. 6 0) ; 4. 3 1 1 1 (1. 1 5) ; 4. 2 7 5 9 (1. 1 7) ; 4. 2 5 1 5 (0. 6 3) ; 3. 3 2 3 0 (186. 5 7) ; 3. 3 1 8 3 (185. 4 8) ; 3. 2 9 6 3 (2. 1 4) ; 2. 6 7 9 1 (0. 6 5) ; 2. 6 7 4 8 (1. 2 3) ; 2. 6 6 9 9 (1. 7 7) ; 2. 6 6 5 8 (1. 2 8) ; 2. 5 4 0 3 (2. 6 0) ; 2. 5 2 3 3 (2. 9 6) ; 2. 5 0 5 2 (190. 7 0) ; 2. 5 0 1 1 (256. 8 0) ; 2. 4 9 7 5 (177. 7 6) ; 2. 4 6 7 0 (0. 5 2) ; 2. 3 3 7 0 (0. 6 5) ; 2. 3 3 2 4 (1. 3 2) ; 2. 3 2 7 7 (1. 6 7) ; 2. 3 2 3 2 (1. 2 8) ; 1. 9 4 2 8 (5. 1 9) ; 1. 3 3 5 3 (0. 3 2) ; 1. 2 9 8 1 (0. 3 4) ; 1. 2 5 8 9 (0. 4 8) ; 1. 2 4 3 5 (0. 5 3) ; 1. 2 3 5 4 (0. 7 4) ; 1. 0 0 5 3 (16. 0 0) ; 0. 9 7 5 4 (0. 4 7) ; 0. 9 5 5 2 (0. 3 3) ; 0. 9 1 1 5 (0. 4 2) ; 0. 8 8 5 2 (1. 2 4) ; 0. 8 4 1 2 (0. 8 5) ; 0. 1 4 5 7 (0. 3 3) ; 0. 0 0 8 0 (2. 3 5) ; -0. 0 0 0 2 (85. 8 5) ; -0. 0 0 8 5 (2. 6 3) ; -0. 1 4 9 8 (0. 3 8)	10
实施例 4 3 [DMSO-d ₆] 7. 6 7 2 9 (0. 3 6) ; 7. 6 6 9 4 (0. 3 7) ; 7. 5 7 5 3 (0. 4 0) ; 7. 5 6 1 6 (2. 5 4) ; 7. 5 5 7 8 (4. 2 6) ; 7. 5 4 3 4 (2. 4 1) ; 7. 4 5 8 3 (3. 6 0) ; 7. 4 4 1 8 (0. 5 7) ; 7. 4 3 7 9 (0. 3 2) ; 7. 4 0 3 2 (1. 4 7) ; 7. 3 9 9 5 (1. 4 1) ; 7. 3 8 9 3 (1. 2 6) ; 7. 3 8 5 6 (1. 2 1) ; 6. 7 7 9 6 (0. 5 5) ; 5. 9 2 2 3 (0. 3 2) ; 5. 9 1 3 6 (0. 3 5) ; 5. 3 3 6 2 (0. 3 4) ; 5. 2 9 5 6 (3. 4 6) ; 5. 1 8 3 3 (0. 3 3) ; 5. 1 1 4 4 (0. 3 6) ; 4. 0 6 0 0 (0. 5 4) ; 4. 0 5 1 7 (0. 5 4) ; 3. 4 5 9 3 (1. 6 0) ; 3. 4 3 6 0 (1. 7 6) ; 3. 4 1 5 9 (1. 3 3) ;	20
	30

3.3910 (1.46); 3.3496 (50.10); 3.0106 (1.61); 2.9872 (1.44); 2.8750 (1.35); 2.8500 (1.25); 2.5251 (0.35); 2.5220 (0.44); 2.5189 (0.51); 2.5098 (9.60); 2.5070 (19.67); 2.5041 (26.50); 2.5011 (19.54); 2.4983 (9.39); 1.3967 (16.00); 1.3859 (0.69); 1.2709 (0.42); 1.2679 (0.40); 0.9610 (0.38); 0.9586 (0.41); 0.9525 (0.66); 0.9433 (0.66); 0.9408 (0.75); 0.9323 (0.64); 0.9171 (0.60); 0.9087 (0.71); 0.9066 (0.75); 0.8977 (0.72); 0.8911 (0.36); 0.8886 (0.42); 0.8798 (0.36); 0.7468 (0.40); 0.7374 (0.51); 0.7356 (0.52); 0.7284 (0.79); 0.7196 (0.67); 0.7178 (0.70); 0.7092 (0.46); 0.6315 (0.49); 0.6233 (0.60); 0.6205 (0.61); 0.6141 (0.61); 0.6124 (0.65); 0.6056 (0.45); 0.6026 (0.48); 0.5938 (0.33); -0.0002 (1.48)

10

20

使用例

実施例A：うどんこ病菌 (*Blumeria graminis*) 試験 (オオムギ) / 保護

溶媒：N，N－ジメチルアセトアミド49重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル1重量部

適切な有効成分製剤を製造するため、有効成分1重量部を所定量の溶媒および乳化剤と混和し、得られた濃縮液を水で希釈して所望の濃度とする。保護活性を調べるため、若い植物に記載の施用量で有効成分の製剤を噴霧する。噴霧コーティングが乾燥した後、植物にオオムギうどんこ病菌 (*Blumeria graminis* f. sp. *hord* *e* *i*) の胞子を散粉する。植物を温度約18℃および相対空気湿度約80%の温室に置いて、うどんこ病膿疱の発生を促進する。接種から7日後に評価を行う。0%は対照の効力に相当する効力を意味し、100%の効力は感染が全く観察されないことを意味する。この試験では、有効成分濃度500ppmの下記の本発明の化合物が、70%以上の効力を示している。

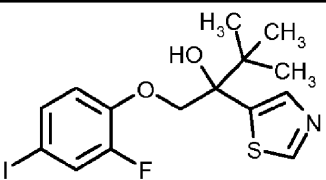
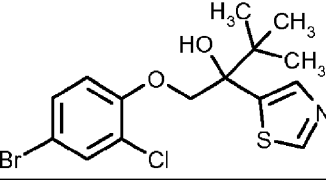
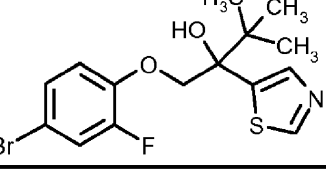
30

【0240】

表A：うどんこ病菌試験 (オオムギ) / 保護

【0241】

【表 3】

番号	有効成分	施用量 (ppm)	効力 (%)
1		500	100
2		500	100
3		500	100

実施例 B：ふ枯れ病菌 (*Leptosphaeria nodorum*) 試験 (コムギ) / 保護

溶媒：N，N-ジメチルアセトアミド 49 重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル 1 重量部

適切な有効成分製剤を製造するため、有効成分 1 重量部を所定量の溶媒および乳化剤と混和し、得られた濃縮液を水で希釈して所望の濃度とする。保護活性を調べるため、若い植物に記載の施用量で有効成分の製剤を噴霧する。噴霧コーティングが乾燥した後、植物にコムギふ枯れ病菌 (*Leptosphaeria nodorum*) の孢子懸濁液で胞子を噴霧する。植物を温度 20℃ および相対空気湿度 100% のインキュベーションキャビンに 48 時間残す。植物を温度約 22℃ および相対空気湿度約 80% の温室に置く。接種から 8 日後に評価を行う。0% は対照の効力に相当する効力を意味し、100% の効力は感染が全く観察されないことを意味する。この試験では、有効成分濃度 500 ppm の下記の本発明の化合物が、70% 以上の効力を示している。

【0242】

表 B：ふ枯れ病菌試験 (コムギ) / 保護

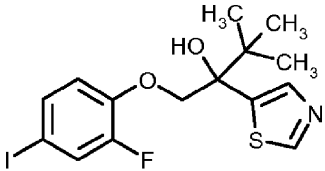
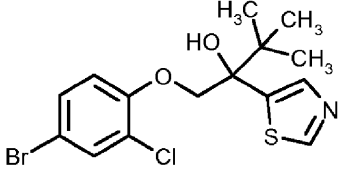
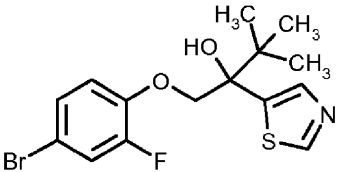
【0243】

10

20

30

【表 4】

番号	有効成分	施用量 (ppm)	効力 (%)
1		500	100
2		500	92
3		500	100

実施例 C：赤さび病菌 (*Puccinia triticina*) 試験 (コムギ) / 保護

溶媒：N，N-ジメチルアセトアミド 49 重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル 1 重量部

適切な有効成分製剤を製造するため、有効成分 1 重量部を所定量の溶媒および乳化剤と混和し、得られた濃縮液を水で希釈して所望の濃度とする。保護活性を調べるため、若い植物に記載の施用量で有効成分の製剤を噴霧する。噴霧コーティングが乾燥した後、植物に赤さび病菌 (*Puccinia triticina*) の孢子懸濁液で孢子を噴霧する。植物を温度 20℃ および相対空気湿度 100% のインキュベーションキャビンに 48 時間残す。植物を温度約 20℃ および相対空気湿度約 80% の温室に置く。接種から 8 日後に評価を行う。0% は対照の効力に相当する効力を意味し、100% の効力は感染が全く観察されないことを意味する。この試験では、有効成分濃度 500 ppm の下記の本発明の化合物が、70% 以上の効力を示している。

【0244】

表 C：赤さび病菌試験 (コムギ) / 保護

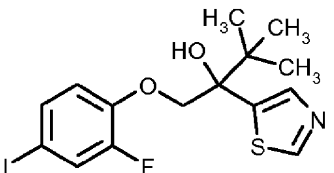
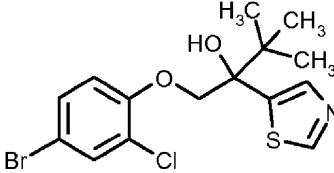
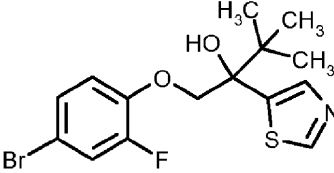
【0245】

10

20

30

【表 5】

番号	有効成分	施用量 (ppm)	効力 (%)
1		500	100
2		500	95
3		500	100

実施例 D：さび病菌 (*Uromyces*) 試験 (マメ) / 保護

溶媒：アセトン 24.5 重量部

ジメチルアセトアミド 24.5 重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル 1 重量部

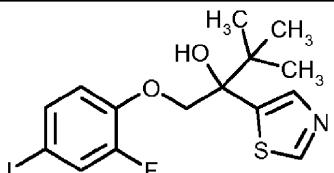
適切な有効成分製剤を製造するため、有効成分 1 重量部を所定量の溶媒および乳化剤と混和し、得られた濃縮液を水で希釈して所望の濃度とする。保護活性を調べるため、若い植物に記載の施用量で有効成分の製剤を噴霧する。噴霧コーティングが乾燥した後、植物にマメさび病病原体ウロミセス・アペンディクラツス (*Uromyces appendiculatus*) の水系孢子懸濁液を接種し、それを温度約 20℃および相対空気湿度 100%のインキュベーションキャビンに 1 日間残す。次に、植物を温度約 21℃および相対空気湿度約 90%の温室に置く。接種から 10 日後に評価を行う。0%は対照の効力に相当する効力を意味し、100%の効力は感染が全く観察されないことを意味する。この試験では、有効成分濃度 100 ppm の下記の本発明の化合物が、70%以上の効力を示している。

【0246】

表 D：さび病菌試験 (マメ) / 保護

【0247】

【表 6】

番号	有効成分	施用量 (ppm)	効力 (%)
1		100	100

実施例 E：黒星病菌 (*Venturia*) 試験 (リンゴ) / 保護

溶媒：アセトン 24.5 重量部

ジメチルアセトアミド 24.5 重量部

乳化剤：アルキルアリールポリグリコールエーテル 1 重量部

適切な有効成分製剤を製造するため、有効成分 1 重量部を所定量の溶媒および乳化剤と混和し、得られた濃縮液を水で希釈して所望の濃度とする。保護活性を調べるため、若い植物に記載の施用量で有効成分の製剤を噴霧する。噴霧コーティングが乾燥した後、植物

にリンゴ黒星病病原体ベンチュリア・イナエクアリス (*Venturia inaequalis*) の水系分生子懸濁液を接種し、それを温度約 20℃および相対空気湿度 100% のインキュベーションキャビンに 1 日間残す。次に、植物を温度約 21℃および相対空気湿度約 90% の温室に置く。接種から 10 日後に評価を行う。0% は対照の効力に相当する効力を意味し、100% の効力は感染が全く観察されないことを意味する。この試験では、有効成分濃度 100 ppm の下記の本発明の化合物が、70% 以上の効力を示している。

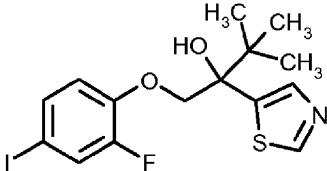
【0248】

表 E：黒星病菌試験（リンゴ）／保護

【0249】

10

【表 7】

番号	有効成分	施用量 (ppm)	効力 (%)
1		100	97

フロントページの続き

- (74)代理人 100124855
弁理士 坪倉 道明
- (74)代理人 100129713
弁理士 重森 一輝
- (74)代理人 100137213
弁理士 安藤 健司
- (74)代理人 230105223
弁護士 城山 康文
- (72)発明者 ニシング, カール・フリードリツヒ
ドイツ国、5 1 3 8 1・レバークーゼン、ヒューシエンダー・シュトラッセ・3 8・ツエー
- (72)発明者 ヘルムケ, ヘンドリツク
ドイツ国、6 5 8 3 5・リーデラーバツハ、ザム・モーゲングラベン・2 2
- (72)発明者 クリストー, ピエール
フランス国、エフー6 9 0 0 9・リヨン、リュ・マリートン・4
- (72)発明者 ペリス, ゴルカ
ドイツ国、5 0 7 3 3・ケルン、クリスチナシュトラッセ・3 9
- (72)発明者 土屋 知己
フランス国、6 9 0 0 9・リヨン、リュ・ジヤン・マリー・ルクレール・1 6、バイエル・エス・
アー・エス気付
- (72)発明者 バスナイレ, ピエール
ドイツ国、4 0 2 2 5・デュツセルドルフ、クリストフシュトラッセ・5 5
- (72)発明者 ベンテイング, ユルゲン
ドイツ国、4 2 7 9 9・ライヒリンゲン、アムゼルシュトラッセ・7
- (72)発明者 ダーメン, ペーター
ドイツ国、4 1 4 7 0・ノイス、アルテブルツカー・シュトラッセ・6 1
- (72)発明者 ヴアツヘンドルフ・ノイマン, ウルリケ
ドイツ国、5 6 5 6 6・ノイヴァイト、オーベラー・マーケンベーク・8 5

審査官 瀬下 浩一

- (56)参考文献 特開平0 3－0 5 8 9 7 9 (JP, A)
特開平0 2－2 9 5 9 8 3 (JP, A)
特表2 0 0 1－5 2 6 2 7 7 (JP, A)
特開昭5 7－0 7 0 8 8 5 (JP, A)
特表2 0 1 3－5 3 1 6 3 1 (JP, A)
特表2 0 1 3－5 2 8 1 7 0 (JP, A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C 0 7 D 2 7 7 / 2 4
C 0 7 D 2 7 7 / 3 2
A 0 1 N 4 3 / 7 8
A 0 1 P 3 / 0 0
A 0 1 P 2 1 / 0 0
CAp l u s / R E G I S T R Y (STN)