

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2014-516064

(P2014-516064A)

(43) 公表日 平成26年7月7日(2014.7.7)

(51) Int.Cl.	F 1	テーマコード (参考)
AO1N 43/80 (2006.01)	AO1N 43/80	101 4H011
AO1N 43/90 (2006.01)	AO1N 43/90	105
AO1N 37/36 (2006.01)	AO1N 37/36	
AO1N 43/40 (2006.01)	AO1N 43/40	101J
AO1N 47/34 (2006.01)	AO1N 47/34	A

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 103 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2014-514021 (P2014-514021)	(71) 出願人	512151078 バイエル・インテレクチュアル・プロパティ イー・ゲー・エム・ペー・ハー ドイツ国、40789・モンハイム、アル フレートーノベルーシュトラーセ・10
(86) (22) 出願日	平成24年6月4日 (2012.6.4)	(74) 代理人	100146318 弁理士 岩瀬 吉和
(85) 翻訳文提出日	平成26年1月23日 (2014.1.23)	(74) 代理人	100114188 弁理士 小野 誠
(86) 國際出願番号	PCT/EP2012/060508	(74) 代理人	100119253 弁理士 金山 賢教
(87) 國際公開番号	W02012/168188	(74) 代理人	100124855 弁理士 坪倉 道明
(87) 國際公開日	平成24年12月13日 (2012.12.13)	(74) 代理人	100129713 弁理士 重森 一輝
(31) 優先権主張番号	11168904.8		
(32) 優先日	平成23年6月7日 (2011.6.7)		
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)		
(31) 優先権主張番号	61/494,105		
(32) 優先日	平成23年6月7日 (2011.6.7)		
(33) 優先権主張国	米国 (US)		

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】活性化合物組み合わせ

(57) 【要約】

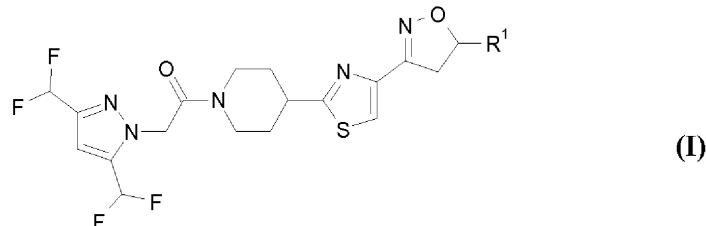
本発明は、特には殺菌剤組成物内の、式(I)のチアゾリルイソオキサゾリン(A)および別の殺菌活性化合物(B)を含む活性化合物組み合わせに関するものである。さらに、本発明は、植物もしくは作物の植物病原性真菌を治療的もしくは予防的に防除する方法、種子処理のための本発明による組み合わせの使用、種子の保護方法、そして処理された種子に関するものである。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

(A) 少なくとも一つの式(I)のチアゾリルイソオキサゾリン：

【化 1】



10

[式中、R¹は、少なくとも1個のプロブ-2-イン-1-イルオキシで置換されており、メチル、メトキシ、フルオロもしくはクロロからなる群から選択される1個、2個もしくは3個の置換基によってさらに置換されていても良いフェニルを表す。] または該化合物の農薬として許容される塩、

ならびに

(B) 下記の群：

エルゴステロール合成の阻害剤、
 複合体IまたはIIでの呼吸鎖の阻害剤、
 複合体IIIでの呼吸鎖の阻害剤、
 有糸分裂および細胞分裂の阻害剤、
 多部位作用を有することができる化合物、
 宿主防御を誘発することができる化合物、
 アミノ酸および/またはタンパク質生合成の阻害剤、
 ATP産生の阻害剤、
 細胞壁合成の阻害剤、
 脂質および膜合成の阻害剤、
 メラニン生合成の阻害剤、
 核酸合成の阻害剤、
 シグナル伝達の阻害剤、
 脱共役剤として作用することができる化合物、
 他の殺菌剤

20

から選択される少なくとも一つの別の活性化合物
 を含む組み合わせ。

30

【請求項 2】

(I-1) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I-2) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[4-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I-3) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[3-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I-4) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2,6-ジフルオロ-4-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

40

(I-5) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2,6-ジフルオロ-4-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

50

アゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン、
 (I - 5) 2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル]
 - 1 - [4 - (4 - { 5 - [2 - フルオロ - 6 - (プロプ - 2 - イン - 1 - イルオキシ)
 フェニル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾー
 ル - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン、
 (I - 6) 2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル]
 - 1 - [4 - (4 - { 5 - [2 - クロロ - 6 - (プロプ - 2 - イン - 1 - イルオキシ)
 フェニル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾー
 ル - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン、
 (I - 7) 2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル]
 - 1 - [4 - (4 - { 5 - [2 , 6 - ジフルオロ - 3 - (プロプ - 2 - イン - 1 - イルオ
 キシ) フェニル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾー
 ル - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン、
 (I - 8) 2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル]
 - 1 - [4 - (4 - { 5 - [5 - フルオロ - 2 - (プロプ - 2 - イン - 1 - イルオキシ)
 フェニル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾー
 ル - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン、
 (I - 9) 2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル]
 - 1 - [4 - (4 - { 5 - [4 - メトキシ - 2 - (プロプ - 2 - イン - 1 - イルオキシ)
 フェニル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾー
 ル - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン、
 (I - 10) 2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル]
 - 1 - [4 - (4 - { 5 - [3 - フルオロ - 2 - (プロプ - 2 - イン - 1 - イルオキシ)
 フェニル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾー
 ル - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン
 からなる群から選択される少なくとも一つの式 (I) の化合物を含む請求項 1 に記載の組
 み合わせ。

【請求項 3】

下記の群 : (2 . 1) ビキサフェン、(2 . 2) ボスカリド、(2 . 6) フルオピラム
 、(2 . 8) フルキサピロキサド、(2 . 11) イソピラザム (シンエピマー性ラセミ体
 1 R S , 4 S R , 9 R S およびアンチエピマー性ラセミ体 1 R S , 4 S R , 9 S R の混合
 物)、(2 . 12) イソピラザム (アンチエピマー性ラセミ体 1 R S , 4 S R , 9 S R)
 、(2 . 13) イソピラザム (アンチエピマー性エナンチオマー 1 R , 4 S , 9 S)、(2 .
 14) イソピラザム (アンチエピマー性エナンチオマー 1 S , 4 R , 9 R)、(2 .
 15) イソピラザム (シンエピマー性ラセミ体 1 R S , 4 S R , 9 R S)、(2 . 16)
 イソピラザム (シンエピマー性エナンチオマー 1 R , 4 S , 9 R)、(2 . 17) イソピ
 ラザム (シンエピマー性エナンチオマー 1 S , 4 R , 9 S)、(2 . 27) N - [1 -
 (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 - メトキシプロパン - 2 - イル] - 3 - (ジフルオロメ
 チル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2 . 29) N - [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] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサ
 ミド、(3 . 1) アメトクトラジン、(3 . 2) アミスルプロム、(3 . 3) アゾキシス
 トロビン、(3 . 4) シアゾファミド、(3 . 9) ファモキサドン、(3 . 10) フェン
 アミドン、(3 . 12) フルオキサストロビン、(3 . 16) ピコキシストロビン、(3 .
 17) ピラクロストロビン、(3 . 22) トリフロキシストロビン、(4 . 6) フルオ
 ピコリド、(5 . 1) ボルドー液、(5 . 4) クロロタロニル、(5 . 5) 水酸化銅、(5 .
 7) 酸化銅、(5 . 8) オキシ塩化銅、(5 . 9) 硫酸銅 (2+) 、(5 . 16) ホ
 ルペット、(5 . 23) マンコゼブ、(5 . 25) メチラム、(5 . 26) メチラム亜鉛
 、(5 . 29) プロピネブ、(5 . 30) 硫黄および多硫化カルシウムなどの硫黄剤、(7 .
 7) ピリメタニル、(9 . 2) ジメトモルフ、(9 . 4) イプロバリカルブ、(9 .

10

20

30

40

50

5) マンジプロパミド、(1 0 . 9) プロパモカルブ、(1 0 . 1 0) プロパモカルブ塩酸塩、(1 2 . 9) メタラキシル、(1 2 . 1 0) メタラキシル - M (メフェノキサム) 、(1 4 . 4) フルアジナム、(1 5 . 9) シモキサニル、(1 5 . 2 4) ホセチル - アルミニウム、(1 5 . 2 5) ホセチル - カルシウム、(1 5 . 2 6) ホセチル - ナトリウム、(1 5 . 4 1) リン酸およびその塩、(1 5 . 4 2) プロパモカルブ - ホセチレート、(1 5 . 5 4) 1 - (4 - { 4 - [(5 R) - 5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン、(1 5 . 5 5) 1 - (4 - { 4 - [(5 S) - 5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン、(1 5 . 5 6) 1 - (4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン、(1 5 . 6 0) 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) - テトロン、(1 5 . 9 0) ペンチル { 6 - [({ [(1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) (フェニル) メチリデン] アミノ } オキシ) メチル] ピリジン - 2 - イル } カーバメートから選択される少なくとも一つの別の活性化合物 (B) を含む請求項 1 に記載の組み合わせ。
10

【請求項 4】

1 : 1 0 0 から 1 0 0 : 1 の重量比で混合相手 (A) : (B) を混合することを含む請求項 1 から 3 のうちのいずれか 1 項に記載の組み合わせ。

【請求項 5】

請求項 1 、 2 、 3 または 4 に記載の活性化合物組み合わせを含み、さらに補助剤、溶媒、担体、界面活性剤または增量剤を含む組成物。

【請求項 6】

請求項 1 、 2 、 3 または 4 に記載の活性化合物組み合わせまたは請求項 5 に記載の組成物を、種子、植物、植物の果実または植物が成長するか成長すると考えられる土壤に施用することを特徴とする、作物保護における植物病原性真菌の防除方法。
30

【請求項 7】

植物、植物の果実または植物が成長するか成長すると考えられる土壤を処理することを特徴とする請求項 6 に記載の方法。

【請求項 8】

葉の処理では 0 . 1 から 1 0 0 0 0 g / h a を、種子処理では 2 から 2 0 0 g / 種子 1 0 0 k g を用いることを特徴とする請求項 6 に記載の方法。

【請求項 9】

作物保護における望ましくない植物病原性真菌を防除するための、請求項 1 、 2 、 3 もしくは 4 に記載の活性化合物組み合わせまたは請求項 5 に記載の組成物の使用。

【請求項 10】

種子、トランスジェニック植物の種子およびトランスジェニック植物を処理するための、請求項に記載の活性化合物組み合わせまたは請求項 5 に記載の組成物の使用。
40

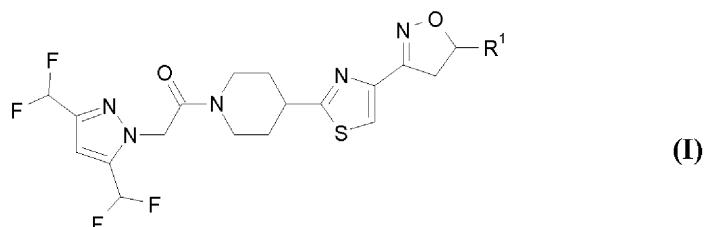
【請求項 11】

請求項 1 、 2 、 3 もしくは 4 に記載の活性化合物組み合わせまたは請求項 5 に記載の組成物で処理された種子。

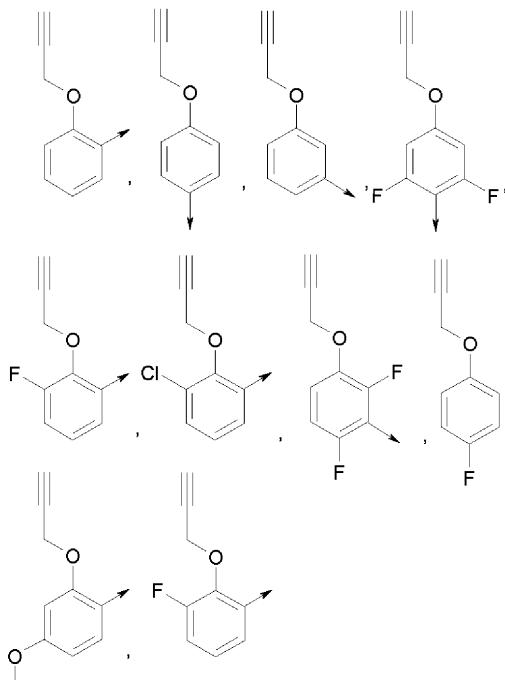
【請求項 12】

下記式 (I) のチアゾリルイソオキサゾリン。

【化2】



[式中、
R¹は、
【化3】



10

20

30

である。】

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、式(I)のチアゾリルイソオキサゾリン(A)および別の殺菌活性化合物(B)を含む、特には殺菌剤組成物の範囲内での活性化合物組み合わせに関するものである。さらに、本発明は、植物もしくは作物の植物病原性真菌を治療的もしくは予防的に防除する方法、種子処理のための本発明による組み合わせの使用、種子を保護する方法、そして処理された種子に関するものである。

【背景技術】

【0002】

ある種のチアゾリルイソオキサゾリンを殺菌剤として用いることは公知である(WO 08/013925、WO 09/094407、WO 09/094445、WO 09/055514およびPCT/EP2010/070156参照)。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献1】WO 08/013925

【特許文献2】WO 09/094407

【特許文献3】WO 09/094445

40

50

【特許文献4】WO 09 / 055514

【特許文献5】PCT / EP 2010 / 070156

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

例えば作用スペクトラム、毒性、選択性、施用量、残留物形成および好ましい製造能力に関して現代の作物保護組成物に課された環境的および経済的要件が常に高まっていることから、そしてさらに、例えば耐性について問題がある可能性があることから、一部の分野で、上記の要件を達成する上で少なくとも役立つ新たな組成物、特には殺菌剤を開発する研究が常に行われている。

10

【課題を解決するための手段】

【0005】

本発明は、一部の態様において、少なくとも上記の目的を達成する活性化合物組み合わせ／組成物を提供する。

【0006】

驚くべきことに、本発明による組み合わせが、基本的に予想されるべき防除対象の植物病原体に関する作用スペクトラムの相加的促進をもたらすだけではなく、二つの方法で成分(A)および成分(B)の作用範囲を拡大する相乗効果を達成することが認められている。第1に、作用の良好性は等しく維持しながら、成分(A)および成分(B)の施用量を低下させる。第2に、その組み合わせはなお、当該2種類の個々の化合物はそのような低施用量範囲で完全に無効となっている場合であっても、高度の植物病原体防除を達成する。一方で、これによって、防除できる植物病原体のスペクトラムの大幅な拡大が可能となり、他方で使用における安全性が高まる。

20

【0007】

相乗的殺菌活性に加えて、本発明による活性化合物組み合わせはさらに、より広い意味で相乗的と称することもできる、さらに別の驚くべき特性を有しており、それには例えば他の植物病原体、例えば植物疾患の抵抗性株に対する活性スペクトラムの拡大；活性化合物の施用量低減；個々の化合物が活性を全く示さないかほとんど示さない施用量であっても本発明による活性化合物組み合わせを利用した有害生物の十分な防除；製剤時または使用時、例えば粉碎、篩い分け、乳化、溶解または分配時の有利な挙動；改善された貯蔵安定性および光安定性；有利な残留物形成；改善された毒性的もしくは生態毒性的挙動；改善された植物特性、例えば、より良好な成長、収穫量増加、より良好な発達根系、より大きい葉面積、より緑の深い葉、より強い新芽、必要な種子の低減、植物毒性の低下、植物の防御系の動員、植物との良好な適合性などがある。従って、本発明による活性化合物組み合わせまたは組成物の使用は、若い穀物を健常に維持するのに大きく貢献し、それは例えば、処理される穀物種子の冬期生存率を高め、品質および収量を保全するものもある。さらに、本発明による活性化合物組み合わせは、全身作用促進に寄与し得る。当該組み合わせの個々の化合物が十分な全身特性を持たない場合であっても、本発明による活性化合物組み合わせはなお、この特性を有することができる。同様にして、本発明による活性化合物組み合わせによって、殺菌活性の持続性が高くなり得る。

30

【0008】

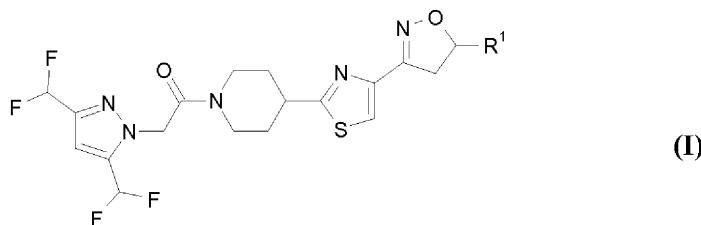
従って、本発明は、

(A)少なくとも一つの式(I)のチアゾリルイソオキサゾリン：

40

【0009】

【化1】



[式中、R¹は、少なくとも1個のプロブ-2-イン-1-イルオキシで置換されており、メチル、メトキシ、フルオロもしくはクロロからなる群から選択される1個、2個もしくは3個の置換基によってさらに置換されていても良いフェニルを表す。] またはそれの農薬として許容される塩、

ならびに

(B) 下記の群：

- (1) エルゴステロール合成の阻害剤、
- (2) 複合体IまたはIIでの呼吸鎖の阻害剤、
- (3) 複合体IIIでの呼吸鎖の阻害剤、
- (4) 有糸分裂および細胞分裂の阻害剤、
- (5) 多部位作用を有することができる化合物、
- (6) 宿主防御を誘発することができる化合物、
- (7) アミノ酸および/またはタンパク質生合成の阻害剤、
- (8) ATP産生の阻害剤、
- (9) 細胞壁合成の阻害剤、
- (10) 脂質および膜合成の阻害剤、
- (11) メラニン生合成の阻害剤、
- (12) 核酸合成の阻害剤、
- (13) シグナル伝達の阻害剤、
- (14) 脱共役剤として作用することができる化合物、
- (15) 他の殺菌剤

から選択される少なくとも一つの別の活性化合物

を含む組み合わせを提供する。

【発明を実施するための形態】

【0010】

好ましいものは、

(I-1) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I-2) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[4-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I-3) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[3-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I-4) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2,6-ジフルオロ-4-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

10

20

30

40

50

(I-5) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I-6) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I-7) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2,6-ジフルオロ-3-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I-8) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[5-フルオロ-2-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I-9) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[4-メトキシ-2-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I-10) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[3-フルオロ-2-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン

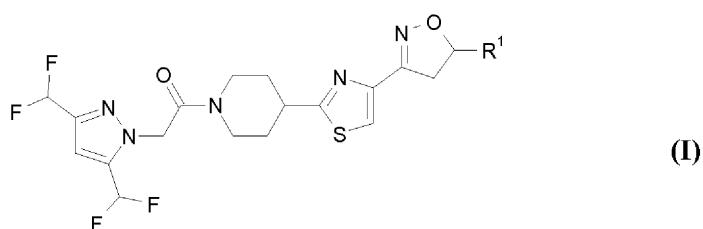
からなる群から選択される少なくとも一つの式(I)の化合物を含む組み合わせである。

【0011】

本発明は、下記式(I)のチアゾリルイソオキサゾリンに関するものもある。

【0012】

【化2】

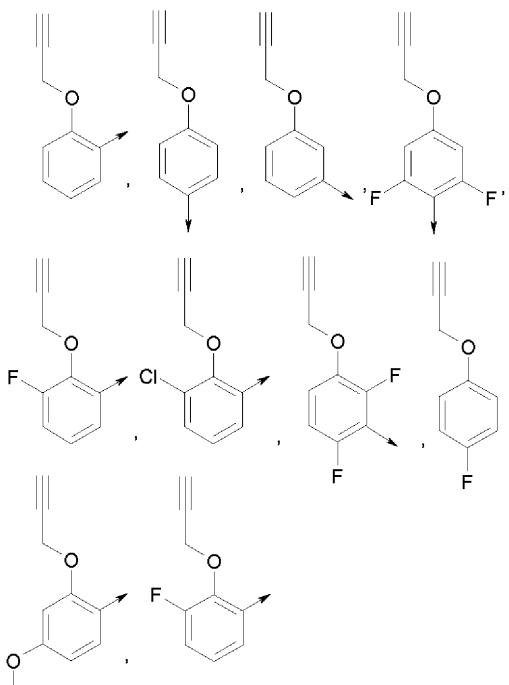


式中、

R¹は、

【0013】

【化3】



10

20

である。

【0014】

本発明による式(I)のチアゾリルイソオキサゾリンは、

(I-1) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロプ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I-2) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[4-(プロプ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I-3) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[3-(プロプ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I-4) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2,6-ジフルオロ-4-(プロプ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I-5) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロプ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I-6) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロプ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I-7) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2,6-ジフルオロ-3-(プロプ-2-イン-1-イルオ

30

40

50

キシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I-8) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[5-フルオロ-2-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、

(I - 9) 2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - [4 - (4 - { 5 - [4 - メトキシ - 2 - (プロブ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン、

(I - 1 0) 2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - [4 - (4 - { 5 - [3 - フルオロ - 2 - (プロプ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン

である。

【 0 0 1 5 】

下の説明において、化合物名に続く括弧内の番号は当該化合物の C A S 登録番号を表す。

【 0 0 1 6 】

別の好ましいものは、下記の群から選択される少なくとも1種類の別の活性化合物(B)を含む組み合わせである。

【 0 0 1 7 】

10

20

30

40

50

2) ピリブチカルブ (8 8 6 7 8 - 6 7 - 5) 、 (1 . 4 3) ピリフェノックス (8 8 2 8 3 - 4 1 - 4) 、 (1 . 4 4) キンコナゾール (1 0 3 9 7 0 - 7 5 - 8) 、 (1 . 4 5) シメコナゾール (1 4 9 5 0 8 - 9 0 - 7) 、 (1 . 4 6) スピロキサミン (1 1 8 1 3 4 - 3 0 - 8) 、 (1 . 4 7) テブコナゾール (1 0 7 5 3 4 - 9 6 - 3) 、 (1 . 4 8) テルビナфин (9 1 1 6 1 - 7 1 - 6) 、 (1 . 4 9) テトラコナゾール (1 1 2 2 8 1 - 7 7 - 3) 、 (1 . 5 0) トリアジメホン (4 3 1 2 1 - 4 3 - 3) 、 (1 . 5 1) トリアジメノール (8 9 4 8 2 - 1 7 - 7) 、 (1 . 5 2) トリデモルフ (8 1 4 1 2 - 4 3 - 3) 、 (1 . 5 3) トリフルミゾール (6 8 6 9 4 - 1 1 - 1) 、 (1 . 5 4) トリホリン (2 6 6 4 4 - 4 6 - 2) 、 (1 . 5 5) トリチコナゾール (1 3 1 9 8 3 - 7 2 - 7) 、 (1 . 5 6) ウニコナゾール (8 3 6 5 7 - 2 2 - 1) 、 (1 . 5 7) 10 ウニコナゾール - p (8 3 6 5 7 - 1 7 - 4) 、 (1 . 5 8) ビニコナゾール (7 7 1 7 4 - 6 6 - 4) 、 (1 . 5 9) ボリコナゾール (1 3 7 2 3 4 - 6 2 - 9) 、 (1 . 6 0) 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 (1 2 9 5 8 6 - 3 2 - 9) 、 (1 . 6 1) 1 - (2 , 2 - ジメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) - 1 H - イミダゾール - 5 - カルボン酸メチル (1 1 0 3 2 3 - 9 5 - 0) 、 (1 . 6 2) N ' - { 5 - (ジフルオロメチル) - 2 - メチル - 4 - [3 - (トリメチルシリル) プロポキシ] フェニル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 (1 . 6 3) N - エチル - N - メチル - N ' - { 2 - メチル - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 - [3 - (トリメチルシリル) プロポキシ] フェニル } イミドホルムアミド、 および、 (1 . 6 4) O - [1 - (4 - メトキシフェノキシ) - 3 , 3 - ジメチルブタン - 2 - イル] - 1 H - イミダゾール - 1 - カルボチオエート (1 1 1 2 2 6 - 7 1 - 2) 。

【 0 0 1 8 】

(2) 複合体 I または II での呼吸鎖の阻害剤、 例えば、 (2 . 1) ビキサフェン (5 8 1 8 0 9 - 4 6 - 3) 、 (2 . 2) ボスカリド (1 8 8 4 2 5 - 8 5 - 6) 、 (2 . 3) カルボキシン (5 2 3 4 - 6 8 - 4) 、 (2 . 4) ジフルメトリム (1 3 0 3 3 9 - 0 7 - 0) 、 (2 . 5) フエンフラム (2 4 6 9 1 - 8 0 - 3) 、 (2 . 6) フルオピラム (6 5 8 0 6 6 - 3 5 - 4) 、 (2 . 7) フルトラニル (6 6 3 3 2 - 9 6 - 5) 、 (2 . 8) フルキサピロキサド (f l u x a p y r o x a d) (9 0 7 2 0 4 - 3 1 - 3) 、 (2 . 9) フラメトピル (1 2 3 5 7 2 - 8 8 - 3) 、 (2 . 1 0) フルメシクロックス (6 0 5 6 8 - 0 5 - 0) 、 (2 . 1 1) イソピラザム (シン - エピマー性ラセミ化合物 (1 R S , 4 S R , 9 R S) とアンチ - エピマー性ラセミ化合物 (1 R S , 4 S R , 9 S R) の混合物) (8 8 1 6 8 5 - 5 8 - 1) 、 (2 . 1 2) イソピラザム (アンチ - エピマー性ラセミ化合物 1 R S , 4 S R , 9 S R) 、 (2 . 1 3) イソピラザム (アンチ - エピマー性エナンチオマー - 1 R , 4 S , 9 S) 、 (2 . 1 4) イソピラザム (アンチ - エピマー性エナンチオマー - 1 S , 4 R , 9 R) 、 (2 . 1 5) イソピラザム (シン - エピマー性ラセミ化合物 1 R S , 4 S R , 9 R S) 、 (2 . 1 6) イソピラザム (シン - エピマー性エナンチオマー - 1 R , 4 S , 9 R) 、 (2 . 1 7) イソピラザム (シン - エピマー性エナンチオマー - 1 S , 4 R , 9 S) 、 (2 . 1 8) メプロニル (5 5 8 1 4 - 4 1 - 0) 、 (2 . 1 9) オキシカルボキシン (5 2 5 9 - 8 8 - 1) 、 (2 . 2 0) ペンフルフェン (4 9 4 7 9 3 - 6 7 - 8) 、 (2 . 2 1) ペンチオピラド (1 8 3 6 7 5 - 8 2 - 3) 、 (2 . 2 2) セダキサン (8 7 4 9 6 7 - 6 7 - 6) 、 (2 . 2 3) チフルザミド (1 3 0 0 0 0 - 4 0 - 7) 、 (2 . 2 4) 1 - メチル - N - [2 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル] - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 2 5) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [2 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ) フェニル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 2 6) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4 - フルオロ - 2 - (1 , 1 , 2 , 3 , 3 - ヘキサフルオロプロポキシ) フェニル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 2 7) N - [1 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 - メトキシプロパン - 2 - イル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラ 40 50

ゾール - 4 - カルボキサミド (1 0 9 2 4 0 0 - 9 5 - 7) (WO 2 0 0 8 1 4 8 5 7 0) 、 (2 . 2 8) 5 , 8 - ジフルオロ - N - [2 - (2 - フルオロ - 4 - { [4 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル] オキシ } フェニル) エチル] キナゾリン - 4 - アミン (1 2 1 0 0 7 0 - 8 4 - 0) (WO 2 0 1 0 0 2 5 4 5 1) 、 (2 . 2 9) N - [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] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (2 . 3 0) N - [(1 S , 4 R) - 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] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドおよび (2 . 3 1) N - [(1 R , 4 S) - 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] - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド。

【 0 0 1 9 】

) - N - メチルエタンアミド、(3.28)2 - クロロ - N - (1,1,3 - トリメチル - 2,3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド(119899 - 14 - 8)、(3.29)5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - (2 - { [((1E) - 1 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチリデン } アミノ) オキシ] メチル } フェニル) - 2,4 - ジヒドロ - 3H - 1,2,4 - トリアゾール - 3 - オン、(3.30)(2E) - 2 - { 2 - [({ シクロプロピル [(4 - メトキシフェニル) イミノ] メチル } スルファニル) メチル] フェニル } - 3 - メトキシプロブ - 2 - エン酸メチル(149601 - 03 - 6)、(3.31)N - (3 - エチル - 3,5,5 - トリメチルシクロヘキシル) - 3 - (ホルミルアミノ) - 2 - ヒドロキシベンズアミド(226551 - 21 - 9)、(3.32)2 - { 2 - [(2,5 - ジメチルフェノキシオキシ) メチル] フェニル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド(173662 - 97 - 0)および(3.33)(2R) - 2 - { 2 - [(2,5 - ジメチルフェノキシオキシ) メチル] フェニル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド(394657 - 24 - 0)。

【0020】

(4) 有糸分裂および細胞分裂の阻害剤、例えば、(4.1)ベノミル(17804 - 35 - 2)、(4.2)カルベンダジム(10605 - 21 - 7)、(4.3)クロルフェナゾール(3574 - 96 - 7)、(4.4)ジエトフェンカルブ(87130 - 20 - 9)、(4.5)エタボキサム(162650 - 77 - 3)、(4.6)フルオピコリド(239110 - 15 - 7)、(4.7)フベリダゾール(3878 - 19 - 1)、(4.8)ペンシクリン(66063 - 05 - 6)、(4.9)チアベンダゾール(148 - 79 - 8)、(4.10)チオファネート - メチル(23564 - 05 - 8)、(4.11)チオファネート(23564 - 06 - 9)、(4.12)ゾキサミド(156052 - 68 - 5)、(4.13)5 - クロロ - 7 - (4 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 6 - (2,4,6 - トリフルオロフェニル) [1,2,4] トリアゾロ [1,5 - a] ピリミジン(214706 - 53 - 3)および(4.14)3 - クロロ - 5 - (6 - クロロピリジン - 3 - イル) - 6 - メチル - 4 - (2,4,6 - トリフルオロフェニル) ピリダジン(1002756 - 87 - 7)。

【0021】

(5) 多部位活性を有することができる化合物、例えば、(5.1)ボルドー液(8011 - 63 - 0)、(5.2)カプタホール(2425 - 06 - 1)、(5.3)キャブタン(133 - 06 - 2)(WO02 / 12172)、(5.4)クロロタロニル(1897 - 45 - 6)、(5.5)水酸化銅(20427 - 59 - 2)、(5.6)ナフテン酸銅(1338 - 02 - 9)、(5.7)酸化銅(1317 - 39 - 1)、(5.8)塩基性塩化銅(1332 - 40 - 7)、(5.9)硫酸銅(2+)(7758 - 98 - 7)、(5.10)ジクロフルアニド(1085 - 98 - 9)、(5.11)ジチアノン(3347 - 22 - 6)、(5.12)ドジン(2439 - 10 - 3)、(5.13)ドジン遊離塩基、(5.14)ファーバム(14484 - 64 - 1)、(5.15)フルオロホルペット(719 - 96 - 0)、(5.16)ホルペット(133 - 07 - 3)、(5.17)グアザチン(108173 - 90 - 6)、(5.18)酢酸グアザチン、(5.19)イミノクタジン(13516 - 27 - 3)、(5.20)イミノクタジンアルベシル酸塩(169202 - 06 - 6)、(5.21)イミノクタジン三酢酸塩(57520 - 17 - 9)、(5.22)マンカッパー(53988 - 93 - 5)、(5.23)マンコゼブ(8018 - 01 - 7)、(5.24)マンネブ(12427 - 38 - 2)、(5.25)メチラム(9006 - 42 - 2)、(5.27)オキシン銅(10380 - 28 - 6)、(5.28)プロパミジン(propamidine)(104 - 32 - 5)、(5.29)プロピネブ(12071 - 83 - 9)、(5.30)硫黄および多硫化カルシウムなどの硫黄剤(7704 - 34 - 9)、(5.31)チウラム(137 - 26 - 8)、(5.32)トリルフルアニド(731 - 27 - 1)、(5.33)ジネブ(12122 - 67 - 7)および(5.34)ジラム(137 - 30 - 4)。

10

20

30

40

50

【0022】

(6)宿主防御を誘発することができる化合物、例えば、(6.1)アシベンゾラル-S-メチル(135158-54-2)、(6.2)イソチアニル(224049-04-1)、(6.3)プロベナゾール(27605-76-1)および(6.4)チアジニル(223580-51-6)。

【0023】

(7)アミノ酸および/またはタンパク質生合成の阻害剤、例えば、(7.1)アンドブリム(andoprilm)(23951-85-1)、(7.2)プラストサイジン-S(2079-00-7)、(7.3)シプロジニル(121552-61-2)、(7.4)カスガマイシン(6980-18-3)、(7.5)カスガマイシン塩酸塩水和物(19408-46-9)、(7.6)メパニピリム(110235-47-7)、(7.7)ピリメタニル(53112-28-0)および(7.8)3-(5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン(861647-32-7)(WO2005070917)。

10

【0024】

(8)ATP産生の阻害剤、例えば、(8.1)酢酸トリフェニルスズ(900-95-8)、(8.2)塩化トリフェニルスズ(639-58-7)、(8.3)水酸化トリフェニルスズ(76-87-9)および(8.4)シルチオファム(175217-20-6)。

20

【0025】

(9)細胞壁合成の阻害剤、例えば、(9.1)ベンチアバリカルブ(177406-68-7)、(9.2)ジメトモルフ(110488-70-5)、(9.3)フルモルフ(211867-47-9)、(9.4)イプロバリカルブ(140923-17-7)、(9.5)マンジプロパミド(374726-62-2)、(9.6)ポリオキシン(111113-80-7)、(9.7)ポリオキソリム(22976-86-9)、(9.8)バリダマイシンA(37248-47-8)および(9.9)バリフェナレート(283159-94-4; 283159-90-0)。

【0026】

(10)脂質および膜合成の阻害剤、例えば、(10.1)ビフェニル(92-52-4)、(10.2)クロロネブ(2675-77-6)、(10.3)ジクロラン(99-30-9)、(10.4)エジフェンホス(17109-49-8)、(10.5)エトリジアゾール(2593-15-9)、(10.6)ヨードカルブ(iodocarb)(55406-53-6)、(10.7)イプロベンホス(26087-47-8)、(10.8)イソプロチオラン(50512-35-1)、(10.9)プロパモカルブ(25606-41-1)、(10.10)プロパモカルブ塩酸塩(25606-41-1)、(10.11)プロチオカルブ(19622-08-3)、(10.12)ピラゾホス(13457-18-6)、(10.13)キントゼン(82-68-8)、(10.14)テクナゼン(117-18-0)および(10.15)トルクロホス-メチル(57018-04-9)。

30

【0027】

(11)メラニン生合成の阻害剤、例えば、(11.1)カルプロパミド(104030-54-8)、(11.2)ジクロシメット(139920-32-4)、(11.3)フェノキサニル(1115852-48-7)、(11.4)フタリド(27355-22-2)、(11.5)ピロキロン(57369-32-1)、(11.6)トリシクラゾール(41814-78-2)および(11.7)2,2,2-トリフルオロエチル{3-メチル-1-[4-メチルベンゾイル]アミノ]ブタン-2-イル}カーバメート(851524-22-6)(WO2005042474)。

40

【0028】

(12)核酸合成の阻害剤、例えば、(12.1)ベナラキシル(71626-11-4)、(12.2)ベナラキシル-M(キララキシル)(98243-83-5)、(1

50

2 . 3) ブピリメート (4 1 4 8 3 - 4 3 - 6) 、 (1 2 . 4) クロジラコン (6 7 9 3 2 - 8 5 - 8) 、 (1 2 . 5) ジメチリモール (5 2 2 1 - 5 3 - 4) 、 (1 2 . 6) エチリモール (2 3 9 4 7 - 6 0 - 6) 、 (1 2 . 7) フララキシル (5 7 6 4 6 - 3 0 - 7) 、 (1 2 . 8) ヒメキサゾール (1 0 0 0 4 - 4 4 - 1) 、 (1 2 . 9) メタラキシル (5 7 8 3 7 - 1 9 - 1) 、 (1 2 . 1 0) メタラキシル - M (メフェノキサム) (7 0 6 3 0 - 1 7 - 0) 、 (1 2 . 1 1) オフラセ (5 8 8 1 0 - 4 8 - 3) 、 (1 2 . 1 2) オキサジキシル (7 7 7 3 2 - 0 9 - 3) および (1 2 . 1 3) オキソリン酸 (1 4 6 9 8 - 2 9 - 4) 。

【 0 0 2 9 】

(1 3) シグナル伝達の阻害剤、例えば、(1 3 . 1) クロゾリネット (8 4 3 3 2 - 8 6 - 5) 、(1 3 . 2) フエンピクロニル (7 4 7 3 8 - 1 7 - 3) 、(1 3 . 3) フルジオキソニル (1 3 1 3 4 1 - 8 6 - 1) 、(1 3 . 4) イプロジオン (3 6 7 3 4 - 1 9 - 7) 、(1 3 . 5) プロシミドン (3 2 8 0 9 - 1 6 - 8) 、(1 3 . 6) キノキシフェン (1 2 4 4 9 5 - 1 8 - 7) および (1 3 . 7) ピンクロゾリン (5 0 4 7 1 - 4 4 - 8) 。

【 0 0 3 0 】

(1 4) 脱共役剤として作用することができる化合物、例えば、(1 4 . 1) ピナパクリル (4 8 5 - 3 1 - 4) 、(1 4 . 2) ジノカップ (1 3 1 - 7 2 - 6) 、(1 4 . 3) フェリムゾン (8 9 2 6 9 - 6 4 - 7) 、(1 4 . 4) フルアジナム (7 9 6 2 2 - 5 9 - 6) および (1 4 . 5) メプチルジノカップ (1 3 1 - 7 2 - 6) 。

【 0 0 3 1 】

(1 5) さらに別の化合物、例えば、(1 5 . 1) ベンチアゾール (2 1 5 6 4 - 1 7 - 0) 、(1 5 . 2) ベトキサジン (1 6 3 2 6 9 - 3 0 - 5) 、(1 5 . 3) カプシマイシン (capsimycin) (7 0 6 9 4 - 0 8 - 5) 、(1 5 . 4) カルボン (9 9 - 4 9 - 0) 、(1 5 . 5) キノメチオネット (2 4 3 9 - 0 1 - 2) 、(1 5 . 6) ピリオフェノン (pyriofenone) (クラザフェノン (chlazafenone)) (6 8 8 0 4 6 - 6 1 - 9) 、(1 5 . 7) クフラネブ (1 1 0 9 6 - 1 8 - 7) 、(1 5 . 8) シフルフェナミド (1 8 0 4 0 9 - 6 0 - 3) 、(1 5 . 9) シモキサニル (5 7 9 6 6 - 9 5 - 7) 、(1 5 . 1 0) シプロスルファミド (2 2 1 6 6 7 - 3 1 - 8) 、(1 5 . 1 1) ダゾメット (5 3 3 - 7 4 - 4) 、(1 5 . 1 2) デバカルブ (6 2 7 3 2 - 9 1 - 6) 、(1 5 . 1 3) ジクロロフェン (9 7 - 2 3 - 4) 、(1 5 . 1 4) ジクロメジン (6 2 8 6 5 - 3 6 - 5) 、(1 5 . 1 5) ジフェンゾコート (4 9 8 6 6 - 8 7 - 7) 、(1 5 . 1 6) ジフェンゾコートメチル硫酸塩 (4 3 2 2 2 - 4 8 - 6) 、(1 5 . 1 7) ジフェニルアミン (1 2 2 - 3 9 - 4) 、(1 5 . 1 8) エコメイト、(1 5 . 1 9) フエンピラザミン (fenpyrazamine) (4 7 3 7 9 8 - 5 9 - 3) 、(1 5 . 2 0) フルメトベル (1 5 4 0 2 5 - 0 4 - 4) 、(1 5 . 2 1) フルオルイミド (4 1 2 0 5 - 2 1 - 4) 、(1 5 . 2 2) フルスルファミド (1 0 6 9 1 7 - 5 2 - 6) 、(1 5 . 2 3) フルチアニル (3 0 4 9 0 0 - 2 5 - 2) 、(1 5 . 2 4) ホセチル - アルミニウム (3 9 1 4 8 - 2 4 - 8) 、(1 5 . 2 5) ホセチル - カルシウム、(1 5 . 2 6) ホセチル - ナトリウム (3 9 1 4 8 - 1 6 - 8) 、(1 5 . 2 7) ヘキサクロロベンゼン (1 1 8 - 7 4 - 1) 、(1 5 . 2 8) イルママイシン (8 1 6 0 4 - 7 3 - 1) 、(1 5 . 2 9) メタスルホカルブ (6 6 9 5 2 - 4 9 - 6) 、(1 5 . 3 0) イソチオシアノ酸メチル (5 5 6 - 6 1 - 6) 、(1 5 . 3 1) メトラフェノン (2 2 0 8 9 9 - 0 3 - 6) 、(1 5 . 3 2) ミルディオマイシン (6 7 5 2 7 - 7 1 - 3) 、(1 5 . 3 3) ナタマイシン (7 6 8 1 - 9 3 - 8) 、(1 5 . 3 4) ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル (1 5 5 2 1 - 6 5 - 0) 、(1 5 . 3 5) ニトロタル - イソプロピル (1 0 5 5 2 - 7 4 - 6) 、(1 5 . 3 6) オクチリノン (2 6 5 3 0 - 2 0 - 1) 、(1 5 . 3 7) オキサモカルブ (oxamocarb) (9 1 7 2 4 2 - 1 2 - 7) 、(1 5 . 3 8) オキシフェンチイン (oxyfenthiin) (3 4 4 0 7 - 8 7 - 9) 、(1 5 . 3 9) ペンタクロロフェノールおよび塩 (8 7 - 8 6 - 5) 、(1

10

20

30

40

50

5 . 4 0) フエノトリン、(1 5 . 4 1) リン酸およびその塩(1 3 5 9 8 - 3 6 - 2)、(1 5 . 4 2) プロパモカルブ - ホセチレート(p r o p a m o c a r b - f o s e t y l a t e)、(1 5 . 4 3) プロパンシン - ナトリウム(p r o p a n o s i n e - s o d i u m) (8 8 4 9 8 - 0 2 - 6)、(1 5 . 4 4) プロキナジド(1 8 9 2 7 8 - 1 2 - 4)、(1 5 . 4 5) ピリモルフ(8 6 8 3 9 0 - 9 0 - 3)、(1 5 . 4 5 e) (2 E) - 3 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - (2 - クロロピリジン - 4 - イル) - 1 - (モルホリン - 4 - イル) プロブ - 2 - エン - 1 - オン(1 2 3 1 7 7 6 - 2 8 - 5)、(1 5 . 4 5 z) (2 Z) - 3 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - (2 - クロロピリジン - 4 - イル) - 1 - (モルホリン - 4 - イル) プロブ - 2 - エン - 1 - オン(1 2 3 1 7 7 6 - 2 9 - 6)、(1 5 . 4 6) ピロールニトリル(1 0 1 8 - 7 1 - 9) (E P - A 1 5 5 9 3 2 0)、(1 5 . 4 7) テブフロキン(3 7 6 6 4 5 - 7 8 - 2)、(1 5 . 4 8) テクロフタラム(7 6 2 8 0 - 9 1 - 6)、(1 5 . 4 9) トルニファニド(3 0 4 9 1 1 - 9 8 - 6)、(1 5 . 5 0) トリアゾキシド(7 2 4 5 9 - 5 8 - 6)、(1 5 . 5 1) トリクラミド(7 0 1 9 3 - 2 1 - 4)、(1 5 . 5 2) ザリラミド(8 4 5 2 7 - 5 1 - 5)、(1 5 . 5 3) 2 - メチルプロパン酸(3 S , 6 S , 7 R , 8 R) - 8 - ベンジル - 3 - [({ 3 - [(イソブチリルオキシ) メトキシ] - 4 - メトキシピリジン - 2 - イル } カルボニル) アミノ] - 6 - メチル - 4 , 9 - ジオキソ - 1 , 5 - ジオキソナン - 7 - イル(5 1 7 8 7 5 - 3 4 - 2) (W O 2 0 0 3 0 3 5 6 1 7)、(1 5 . 5 4) 1 - (4 - { 4 - [(5 R) - 5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン(1 0 0 3 3 1 9 - 7 9 - 6) (W O 2 0 0 8 0 1 3 6 2 2)、(1 5 . 5 5) 1 - (4 - { 4 - [(5 S) - 5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン(1 0 0 3 3 1 9 - 8 0 - 9) (W O 2 0 0 8 0 1 3 6 2 2)、(1 5 . 5 6) 1 - (4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン(1 0 0 3 3 1 8 - 6 7 - 9) (W O 2 0 0 8 0 1 3 6 2 2)、(1 5 . 5 7) 1 - (4 - メトキシフェノキシ) - 3 , 3 - ジメチルブタン - 2 - イル 1 H - イミダゾール - 1 - カルボキシレート(1 1 1 2 2 7 - 1 7 - 9)、(1 5 . 5 8) 2 , 3 , 5 , 6 - テトラクロロ - 4 - (メチルスルホニル) ピリジン(1 3 1 0 8 - 5 2 - 6)、(1 5 . 5 9) 2 , 3 - ジブチル - 6 - クロロチエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 (3 H) - オン(2 2 1 4 5 1 - 5 8 - 7)、(1 5 . 6 0) 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) - テトロン、(1 5 . 6 1) 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - (4 - { 4 - [(5 R) - 5 - フェニル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) エタノン(1 0 0 3 3 1 6 - 5 3 - 7) (W O 2 0 0 8 0 1 3 6 2 2)、(1 5 . 6 2) 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - (4 - { 4 - [(5 S) - 5 - フェニル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) エタノン(1 0 0 3 3 1 6 - 5 4 - 8) (W O 2 0 0 8 0 1 3 6 2 2)、(1 5 . 6 3) 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - { 4 - [4 - (5 - フェニル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] ピペリジン - 1 - イル } エタノン(1 0 0 3 3 1 6 - 5 1 - 5) (W O 2 0 0 8 0 1 3 6 2 2)、(1 5 . 6 4) 2 - ブトキシ - 6 - ヨード - 3 - プロピル - 4 H - クロメン - 4 - オン、(1 5 . 6 5) 2 - クロロ - 5 - [2 - クロロ - 1 - (2 , 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 4 - 10 20 30 40 50

メチル - 1 H - イミダゾール - 5 - イル] ピリジン、(1 5 . 6 6) 2 - フェニルフェノールおよび塩 (9 0 - 4 3 - 7)、(1 5 . 6 7) 3 - (4 , 4 , 5 - トリフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル) キノリン (8 6 1 6 4 7 - 8 5 - 0) (WO 2 0 0 5 0 7 0 9 1 7)、(1 5 . 6 8) 3 , 4 , 5 - トリクロロピリジン - 2 , 6 - ジカルボニトリル (1 7 8 2 4 - 8 5 - 0)、(1 5 . 6 9) 3 - [5 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 - ジメチル - 1 , 2 - オキサゾリジン - 3 - イル] ピリジン、(1 5 . 7 0) 3 - クロロ - 5 - (4 - クロロフェニル) - 4 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 6 - メチルピリダジン、(1 5 . 7 1) 4 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 3 , 6 - ジメチルピリダジン、(1 5 . 7 2) 5 - アミノ - 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - チオール、(1 5 . 7 3) 5 - クロロ - N - フェニル - N - (プロパ - 2 - イン - 1 - イル) チオフェン - 2 - スルホノヒドログリド (1 3 4 - 3 1 - 6)、(1 5 . 7 4) 5 - フルオロ - 2 - [(4 - フルオロベンジル) オキシ] ピリミジン - 4 - アミン (1 1 7 4 3 7 6 - 1 1 - 4) (WO 2 0 0 9 0 9 4 4 4 2)、(1 5 . 7 5) 5 - フルオロ - 2 - [(4 - メチルベンジル) オキシ] ピリミジン - 4 - アミン (1 1 7 4 3 7 6 - 2 5 - 0) (WO 2 0 0 9 0 9 4 4 4 2)、(1 5 . 7 6) 5 - メチル - 6 - オクチル [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 7 - アミン、(1 5 . 7 7) (2 Z) - 3 - アミノ - 2 - シアノ - 3 - フェニルプロパ - 2 - エン酸エチル、(1 5 . 7 8) N - (4 - { [3 - (4 - クロロベンジル) - 1 , 2 , 4 - チアジアゾール - 5 - イル] オキシ } - 2 , 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1 5 . 7 9) N - (4 - クロロベンジル) - 3 - [3 - メトキシ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、(1 5 . 8 0) N - [(4 - クロロフェニル) (シアノ) メチル] - 3 - [3 - メトキシ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、(1 5 . 8 1) N - [(5 - プロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) メチル] - 2 , 4 - ジクロロピリジン - 3 - カルボキサミド、(1 5 . 8 2) N - [1 - (5 - プロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) エチル] - 2 , 4 - ジクロロピリジン - 3 - カルボキサミド、(1 5 . 8 3) N - [1 - (5 - プロモ - 3 - クロロピリジン - 2 - イル) エチル] - 2 - フルオロ - 4 - ヨードピリジン - 3 - カルボキサミド、(1 5 . 8 4) N - { (E) - [(シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 , 3 - ジフルオロフェニル] メチル } - 2 - フェニルアセトアミド (2 2 1 2 0 1 - 9 2 - 9)、(1 5 . 8 5) N - { (Z) - [(シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 , 3 - ジフルオロフェニル] メチル } - 2 - フェニルアセトアミド (2 2 1 2 0 1 - 9 2 - 9)、(1 5 . 8 6) N - { 4 - [(3 - t e r t - ブチル - 4 - シアノ - 1 , 2 - チアゾール - 5 - イル) オキシ] - 2 - クロロ - 5 - メチルフェニル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1 5 . 8 7) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - N - (1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド (9 2 2 5 1 4 - 4 9 - 6) (WO 2 0 0 7 0 1 4 2 9 0)、(1 5 . 8 8) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - N - [(1 S) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド (9 2 2 5 1 4 - 0 7 - 6) (WO 2 0 0 7 0 1 4 2 9 0)、(1 5 . 8 9) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - N - [(1 S) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド (9 2 2 5 1 4 - 4 8 - 5) (WO 2 0 0 7 0 1 4 2 9 0)、(1 5 . 9 0) ペンチル { 6 - [({ [(1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) (フェニル) メチリデン] アミノ } オキシ) メチル] ピリジン - 2 - イル } カーバメート、(1 5 . 9 1) フェナジン - 1 - カルボン酸、(1 5 . 9 2) キノリン - 8 - オール (1 3 4 - 3 1 - 6)、(

15.93) キノリン-8-オールサルフェート(2:1)(134-31-6)および
(15.94) tert-ブチル{6-[({[(1-メチル-1H-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]ピリジン-2-イル}カーバメート。

【0032】

(16) さらに別の化合物、例えば(16.1)1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-N-[2-(トリフルオロメチル)ビフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(16.2)N-(4-クロロビフェニル-2-イル)-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(16.3)N-(2,4-ジクロロビフェニル-2-イル)-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(16.4)3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[4-(トリフルオロメチル)ビフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(16.5)N-(2,5-ジフルオロビフェニル-2-イル)-1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(16.6)3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[4-(プロブ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド(WO2004/058723から公知)、(16.7)5-フルオロ-1,3-ジメチル-N-[4-(プロブ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド(WO2004/058723から公知)、(16.8)2-クロロ-N-[4-(プロブ-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]ピリジン-3-カルボキサミド(WO2004/058723から公知)、(16.9)3-(ジフルオロメチル)-N-[4-(3,3-ジメチルブト-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド(WO2004/058723から公知)、(16.10)N-[4-(3,3-ジメチルブト-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-5-フルオロ-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド(WO2004/058723から公知)、(16.11)3-(ジフルオロメチル)-N-(4-エチニルビフェニル-2-イル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド(WO2004/058723から公知)、(16.12)N-(4-エチニルビフェニル-2-イル)-5-フルオロ-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド(WO2004/058723から公知)、(16.13)2-クロロ-N-(4-エチニルビフェニル-2-イル)ピリジン-3-カルボキサミド(WO2004/058723から公知)、(16.14)2-クロロ-N-[4-(3,3-ジメチルブト-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]ピリジン-3-カルボキサミド(WO2004/058723から公知)、(16.15)4-(ジフルオロメチル)-2-メチル-N-[4-(トリフルオロメチル)ビフェニル-2-イル]-1,3-チアゾール-5-カルボキサミド(WO2004/058723から公知)、(16.16)5-フルオロ-N-[4-(3-ヒドロキシ-3-メチルブト-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド(WO2004/058723から公知)、(16.17)2-クロロ-N-[4-(3-ヒドロキシ-3-メチルブト-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]ピリジン-3-カルボキサミド(WO2004/058723から公知)、(16.18)3-(ジフルオロメチル)-N-[4-(3-メトキシ-3-メチルブト-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド(WO2004/058723から公知)、(16.19)5-フルオロ-N-[4-(3-メトキシ-3-メチルブト-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド(WO2004/058723から公知)、(16.20)2-クロロ-N-[4-(3-メトキシ-3-メチルブト-1-イン-1-イル)ビフェニル-2-イル]ピリジン-3-カルボキサミド(WO2004/058723から公知)、(16.21)(5-プロモ-2-メトキシ-4-メチルピリジン-3-イル)(2,3,4-10
20
30
40
50

トリメトキシ - 6 - メチルフェニル) メタノン (E P - A 1 5 5 9 3 2 0 から公知) 、 (1 6 . 2 2) N - [2 - (4 - { [3 - (4 - クロロフェニル) プロピ - 2 - イン - 1 - イル] オキシ } - 3 - メトキシフェニル) エチル] - N 2 - (メチルスルホニル) バリンアミド (2 2 0 7 0 6 - 9 3 - 4) 、 (1 6 . 2 3) 4 - オキソ - 4 - [(2 - フェニルエチル) アミノ] ブタン酸および (1 6 . 2 4) ブト - 3 - イン - 1 - イル { 6 - [((Z) - (1 - メチル - 1 H - 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] ピリジン - 2 - イル } カーバメート。

〔 0 0 3 3 〕

分類(1)から(16)の全ての言及された混合相手は、その官能基によって可能であるならば、好適な塩基または酸と塩を形成しても良い。

[0 0 3 4]

特に好ましいものにはさらに、下記の群から選択される少なくとも一つの別の活性化合物（B）を含む組み合わせがある。

[0 0 3 5]

(2.1) ビキサフェン、(2.2) ボスカリド、(2.6) フルオピラム、(2.8) フルキサピロキサド、(2.11) イソピラザム(シンエピマー性ラセミ体1RS, 4S, 9RS およびアンチエピマー性ラセミ体1RS, 4SR, 9SRの混合物)、(2.12) イソピラザム(アンチエピマー性ラセミ体1RS, 4SR, 9SR)、(2.13) イソピラザム(アンチエピマー性エナンチオマー1R, 4S, 9S)、(2.14) イソピラザム(アンチエピマー性エナンチオマー1S, 4R, 9R)、(2.15) イソピラザム(シンエピマー性ラセミ体1RS, 4SR, 9RS)、(2.16) イソピラザム(シンエピマー性エナンチオマー1R, 4S, 9R)、(2.17) イソピラザム(シンエピマー性エナンチオマー1S, 4R, 9S)、(2.27) N-[1-(2,4-ジクロロフェニル)-1-メトキシプロパン-2-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.29) N-[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]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(3.1) アメトクトラジン、(3.2) アミスルプロム、(3.3) アゾキシストロビン、(3.4) シアゾファミド、(3.9) ファモキサドン、(3.10) フェンアミドン、

(3 . 1 2) フルオキサストロビン、(3 . 1 6) ピコキシストロビン、(3 . 1 7) ピラクロストロビン、(3 . 2 2) トリフロキシストロビン、(4 . 6) フルオピコリド、(5 . 1) ボルドー液、(5 . 4) クロロタロニル、(5 . 5) 水酸化銅、(5 . 7) 酸化銅、(5 . 8) オキシ塩化銅、(5 . 9) 硫酸銅(2 +)、(5 . 1 6) ホルペット、(5 . 2 3) マンコゼブ、(5 . 2 5) メチラム、(5 . 2 6) メチラム亜鉛、(5 . 2 9) プロピネブ、(5 . 3 0) 硫黄および多硫化カルシウムなどの硫黄剤、(7 . 7) ピリメタニル、(9 . 2) ジメトモルフ、(9 . 4) イプロバリカルブ、(9 . 5) マンジプロパミド、(1 0 . 9) プロパモカルブ、(1 0 . 1 0) プロパモカルブ塩酸塩、(1 2 . 9) メタラキシル、(1 2 . 1 0) メタラキシル - M (メフェノキサム) 、(1 4 . 4) フルアジナム、(1 5 . 9) シモキサニル、(1 5 . 2 4) ホセチル - アルミニウム、(1 5 . 2 5) ホセチル - カルシウム、(1 5 . 2 6) ホセチル - ナトリウム、(1 5 . 4 1) リン酸およびその塩、(1 5 . 4 2) プロパモカルブ - ホセチレート、(1 5 . 5 4) 1 - (4 - { 4 - [(5 R) - 5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン、(1 5 . 5 5) 1 - (4 - { 4 - [(5 S) - 5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン、(1 5 . 5 6) 1 - (4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) - 2 - [5 - メチル -

10

20

30

40

50

- 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン、 (15.60) 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) - テトロン、 (15.90) ペンチル { 6 - [({ [(1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) (フェニル) メチリデン] アミノ } オキシ) メチル] ピリジン - 2 - イル } カーバメート

分類(1)から(15)の全ての言及された混合相手は、その官能基によって可能であるならば、好適な塩基または酸と塩を形成しても良い。

〔 0 0 3 6 〕

10
20
30
40
50

$(4.1), (I-1) + (4.2), (I-1) + (4.3), (I-1) + (4.4), (I-1) + (4.5), (I-1) + (4.6), (I-1) + (4.7), (I-1) + (4.8), (I-1) + (4.9), (I-1) + (4.10), (I-1) + (4.11), (I-1) + (4.12), (I-1) + (4.13), (I-1) + (4.14), (I-1) + (5.1), (I-1) + (5.2), (I-1) + (5.3), (I-1) + (5.4), (I-1) + (5.5), (I-1) + (5.6), (I-1) + (5.7), (I-1) + (5.8), (I-1) + (5.9), (I-1) + (5.10), (I-1) + (5.11), (I-1) + (5.12), (I-1) + (5.13), (I-1) + (5.14), (I-1) + (5.15), (I-1) + (5.16), (I-1) + (5.17), (I-1) + (5.18), (I-1) + (5.19), (I-1) + (5.20), (I-1) + (5.21), (I-1) + (5.22), (I-1) + (5.23), (I-1) + (5.24), (I-1) + (5.25), (I-1) + (5.26), (I-1) + (5.27), (I-1) + (5.28), (I-1) + (5.29), (I-1) + (5.30), (I-1) + (5.31), (I-1) + (5.32), (I-1) + (5.33), (I-1) + (5.34), (I-1) + (6.1), (I-1) + (6.2), (I-1) + (6.3), (I-1) + (6.4), (I-1) + (7.1), (I-1) + (7.2), (I-1) + (7.3), (I-1) + (7.4), (I-1) + (7.5), (I-1) + (7.6), (I-1) + (7.7), (I-1) + (7.8), (I-1) + (8.1), (I-1) + (8.2), (I-1) + (8.3), (I-1) + (8.4), (I-1) + (9.1), (I-1) + (9.2), (I-1) + (9.3), (I-1) + (9.4), (I-1) + (9.5), (I-1) + (9.6), (I-1) + (9.7), (I-1) + (9.8), (I-1) + (9.9), (I-1) + (10.1), (I-1) + (10.2), (I-1) + (10.3), (I-1) + (10.4), (I-1) + (10.5), (I-1) + (10.6), (I-1) + (10.7), (I-1) + (10.8), (I-1) + (10.9), (I-1) + (10.10), (I-1) + (10.11), (I-1) + (10.12), (I-1) + (10.13), (I-1) + (10.14), (I-1) + (10.15), (I-1) + (11.1), (I-1) + (11.2), (I-1) + (11.3), (I-1) + (11.4), (I-1) + (11.5), (I-1) + (11.6), (I-1) + (11.7), (I-1) + (12.1), (I-1) + (12.2), (I-1) + (12.3), (I-1) + (12.4), (I-1) + (12.5), (I-1) + (12.6), (I-1) + (12.7), (I-1) + (12.8), (I-1) + (12.9), (I-1) + (12.10), (I-1) + (12.11), (I-1) + (12.12), (I-1) + (12.13), (I-1) + (13.1), (I-1) + (13.2), (I-1) + (13.3), (I-1) + (13.4), (I-1) + (13.5), (I-1) + (13.6), (I-1) + (13.7), (I-1) + (14.1), (I-1) + (14.2), (I-1) + (14.3), (I-1) + (14.4), (I-1) + (14.5), (I-1) + (15.1), (I-1) + (15.2), (I-1) + (15.3), (I-1) + (15.4), (I-1) + (15.5), (I-1) + (15.6), (I-1) + (15.7), (I-1) + (15.8), (I-1) + (15.9), (I-1) + (15.10), (I-1) + (15.11), (I-1) + (15.12), (I-1) + (15.13), (I-1) + (15.14), (I-1) + (15.15), (I-1) + (15.16), (I-1) + (15.17), (I-1) + (15.18), (I-1) + (15.19), (I-1) + (15.20), (I-1) + (15.21), (I-1) + (15.22), (I-1) + (15.23), (I-1) + (15.24), (I-1) + (15.25), (I-1) + (15.26), (I-1) + (15.27), (I-1) + (15.28), (I-1) + (15.29), (I-1) + (15.30), (I-1) + (15.31), (I-1) + (15.32), (I-1) + (15.33), (I-1) + (15.34), (I-1) + (15.35)$

10

20

30

40

50

5) 、 (I - 1) + (1 5 . 3 6) 、 (I - 1) + (1 5 . 3 7) 、 (I - 1) + (1 5 . 3 8) 、 (I - 1) + (1 5 . 3 9) 、 (I - 1) + (1 5 . 4 1) 、 (I - 1) + (1 5 . 4 2) 、 (I - 1) + (1 5 . 4 3) 、 (I - 1) + (1 5 . 4 4) 、 (I - 1) + (1 5 . 4 5) 、 (I - 1) + (1 5 . 4 6) 、 (I - 1) + (1 5 . 4 7) 、 (I - 1) + (1 5 . 4 8) 、 (I - 1) + (1 5 . 4 9) 、 (I - 1) + (1 5 . 5 0) 、 (I - 1) + (1 5 . 5 1) 、 (I - 1) + (1 5 . 5 2) 、 (I - 1) + (1 5 . 5 3) 、 (I - 1) + (1 5 . 5 4) 、 (I - 1) + (1 5 . 5 5) 、 (I - 1) + (1 5 . 5 6) 、 (I - 1) + (1 5 . 5 7) 、 (I - 1) + (1 5 . 5 8) 、 (I - 1) + (1 5 . 5 9) 、 (I - 1) + (1 5 . 6 0) 、 (I - 1) + (1 5 . 6 1) 、 (I - 1) + (1 5 . 6 2) 、 (I - 1) + (1 5 . 6 3) 、 (I - 1) + (1 5 . 6 4) 、 (I - 1) + (1 5 . 6 5) 、 (I - 1) + (1 5 . 6 6) 、 (I - 1) + (1 5 . 6 7) 、 (I - 1) + (1 5 . 6 8) 、 (I - 1) + (1 5 . 6 9) 、 (I - 1) + (1 5 . 7 0) 、 (I - 1) + (1 5 . 7 1) 、 (I - 1) + (1 5 . 7 2) 、 (I - 1) + (1 5 . 7 3) 、 (I - 1) + (1 5 . 7 4) 、 (I - 1) + (1 5 . 7 5) 、 (I - 1) + (1 5 . 7 6) 、 (I - 1) + (1 5 . 7 7) 、 (I - 1) + (1 5 . 7 8) 、 (I - 1) + (1 5 . 7 9) 、 (I - 1) + (1 5 . 8 0) 、 (I - 1) + (1 5 . 8 1) 、 (I - 1) + (1 5 . 8 2) 、 (I - 1) + (1 5 . 8 3) 、 (I - 1) + (1 5 . 8 4) 、 (I - 1) + (1 5 . 8 5) 、 (I - 1) + (1 5 . 8 6) 、 (I - 1) + (1 5 . 8 7) 、 (I - 1) + (1 5 . 8 8) 、 (I - 1) + (1 5 . 8 9) 、 (I - 1) + (1 5 . 9 0) 、 (I - 1) + (1 5 . 9 1) 、 (I - 1) + (1 5 . 9 2) 、 (I - 1) + (1 5 . 9 3) 、 (I - 1) + (1 5 . 9 4) に関するものである。 10 20

【0037】

別の特に好ましい実施形態において本発明は、式(I)の化合物としての化合物(I-1)および一つの成分(B)を含む混合物、特には混合物(I-1)+(2.1)、(I-1)+(2.2)、(I-1)+(2.6)、(I-1)+(2.8)、(I-1)+(2.11)、(I-1)+(2.12)、(I-1)+(2.13)、(I-1)+(2.14)、(I-1)+(2.15)、(I-1)+(2.16)、(I-1)+(2.17)、(I-1)+(2.29)、(I-1)+(3.1)、(I-1)+(3.2)、(I-1)+(3.3)、(I-1)+(3.4)、(I-1)+(3.9)、(I-1)+(3.10)、(I-1)+(3.12)、(I-1)+(3.16)、(I-1)+(3.17)、(I-1)+(3.22)、(I-1)+(4.6)、(I-1)+(5.1)、(I-1)+(5.4)、(I-1)+(5.5)、(I-1)+(5.7)、(I-1)+(5.8)、(I-1)+(5.9)、(I-1)+(5.16)、(I-1)+(5.23)、(I-1)+(5.25)、(I-1)+(5.26)、(I-1)+(5.29)、(I-1)+(5.30)、(I-1)+(7.7)、(I-1)+(9.2)、(I-1)+(9.4)、(I-1)+(9.5)、(I-1)+(10.9)、(I-1)+(10.10)、(I-1)+(12.9)、(I-1)+(12.10)、(I-1)+(14.4)、(I-1)+(15.9)、(I-1)+(15.24)、(I-1)+(15.25)、(I-1)+(15.26)、(I-1)+(15.41)、(I-1)+(15.42)、(I-1)+(15.54)、(I-1)+(15.55)、(I-1)+(15.56)、(I-1)+(15.60)、(I-1)+(15.90)に関するものである。 30 40

【0038】

ある好ましい実施形態において本発明は、式(I)の化合物としての化合物(I-2)および一つの成分(B)を含む混合物、特には混合物(I-2)+(1.1)、(I-2)+(1.2)、(I-2)+(1.3)、(I-2)+(1.4)、(I-2)+(1.5)、(I-2)+(1.6)、(I-2)+(1.7)、(I-2)+(1.8)、(I-2)+(1.9)、(I-2)+(1.10)、(I-2)+(1.11)、(I-2)+(1.12)、(I-2)+(1.13)、(I-2)+(1.14)、(I-2)+(1.15)、(I-2)+(1.16)、(I-2)+(1.17)、(I-2) 50

$$\begin{aligned}
&) + (1 . 1 8)) , (I - 2) + (1 . 1 9)) , (I - 2) + (1 . 2 0)) , (I - 2) \\
& + (1 . 2 1)) , (I - 2) + (1 . 2 2)) , (I - 2) + (1 . 2 3)) , (I - 2) + \\
& (1 . 2 4)) , (I - 2) + (1 . 2 5)) , (I - 2) + (1 . 2 6)) , (I - 2) + \\
& (1 . 2 7)) , (I - 2) + (1 . 2 8)) , (I - 2) + (1 . 2 9)) , (I - 2) + (1 \\
& . 3 0)) , (I - 2) + (1 . 3 1)) , (I - 2) + (1 . 3 2)) , (I - 2) + (1 . \\
& 3 3)) , (I - 2) + (1 . 3 4)) , (I - 2) + (1 . 3 5)) , (I - 2) + (1 . 3 \\
& 6)) , (I - 2) + (1 . 3 7)) , (I - 2) + (1 . 3 8)) , (I - 2) + (1 . 3 9 \\
&)) , (I - 2) + (1 . 4 0)) , (I - 2) + (1 . 4 1)) , (I - 2) + (1 . 4 2) \\
&) , (I - 2) + (1 . 4 3)) , (I - 2) + (1 . 4 4)) , (I - 2) + (1 . 4 5)) , \\
& (I - 2) + (1 . 4 6)) , (I - 2) + (1 . 4 7)) , (I - 2) + (1 . 4 8)) , (10 \\
& I - 2) + (1 . 4 9)) , (I - 2) + (1 . 5 0)) , (I - 2) + (1 . 5 1)) , (I \\
& - 2) + (1 . 5 2)) , (I - 2) + (1 . 5 3)) , (I - 2) + (1 . 5 4)) , (I \\
& - 2) + (1 . 5 5)) , (I - 2) + (1 . 5 6)) , (I - 2) + (1 . 5 7)) , (I - 2 \\
&) + (1 . 5 8)) , (I - 2) + (1 . 5 9)) , (I - 2) + (1 . 6 0)) , (I - 2) \\
& + (1 . 6 1)) , (I - 2) + (1 . 6 2)) , (I - 2) + (1 . 6 3)) , (I - 2) + \\
& (1 . 6 4)) , (I - 2) + (2 . 1)) , (I - 2) + (2 . 2)) , (I - 2) + (2 . \\
& 3)) , (I - 2) + (2 . 4)) , (I - 2) + (2 . 5)) , (I - 2) + (2 . 6)) , (20 \\
& I - 2) + (2 . 7)) , (I - 2) + (2 . 8)) , (I - 2) + (2 . 9)) , (I - 2) \\
& + (2 . 1 0)) , (I - 2) + (2 . 1 1)) , (I - 2) + (2 . 1 2)) , (I - 2) + \\
& (2 . 1 3)) , (I - 2) + (2 . 1 4)) , (I - 2) + (2 . 1 5)) , (I - 2) + \\
& (2 . 1 6)) , (I - 2) + (2 . 1 7)) , (I - 2) + (2 . 1 8)) , (I - 2) + (2 \\
& . 1 9)) , (I - 2) + (2 . 2 0)) , (I - 2) + (2 . 2 1)) , (I - 2) + (2 . \\
& 2 2)) , (I - 2) + (2 . 2 3)) , (I - 2) + (2 . 2 4)) , (I - 2) + (2 . 2 \\
& 5)) , (I - 2) + (2 . 2 6)) , (I - 2) + (2 . 2 7)) , (I - 2) + (2 . 2 8 \\
&)) , (I - 2) + (2 . 2 9)) , (I - 2) + (3 . 1)) , (I - 2) + (3 . 2)) , (30 \\
& (I - 2) + (3 . 3)) , (I - 2) + (3 . 4)) , (I - 2) + (3 . 5)) , (I - 2) \\
& + (3 . 6)) , (I - 2) + (3 . 7)) , (I - 2) + (3 . 8)) , (I - 2) + (3 . \\
& 9)) , (I - 2) + (3 . 1 0)) , (I - 2) + (3 . 1 1)) , (I - 2) + (3 . 1 2 \\
&)) , (I - 2) + (3 . 1 3)) , (I - 2) + (3 . 1 4)) , (I - 2) + (3 . 1 5) \\
&) , (I - 2) + (3 . 1 6)) , (I - 2) + (3 . 1 7)) , (I - 2) + (3 . 1 8)) , \\
& (I - 2) + (3 . 1 9)) , (I - 2) + (3 . 2 0)) , (I - 2) + (3 . 2 1)) , (I \\
& - 2) + (3 . 2 2)) , (I - 2) + (3 . 2 3)) , (I - 2) + (3 . 2 4)) , (I \\
& - 2) + (3 . 2 5)) , (I - 2) + (3 . 2 6)) , (I - 2) + (3 . 2 7)) , (I \\
& - 2) + (3 . 2 8)) , (I - 2) + (3 . 2 9)) , (I - 2) + (3 . 3 0)) , (I - 2 \\
&) + (3 . 3 1)) , (I - 2) + (3 . 3 2)) , (I - 2) + (3 . 3 3)) , (I - 2) \\
& + (4 . 1)) , (I - 2) + (4 . 2)) , (I - 2) + (4 . 3)) , (I - 2) + (4 . \\
& 4)) , (I - 2) + (4 . 5)) , (I - 2) + (4 . 6)) , (I - 2) + (4 . 7)) , (I \\
& - 2) + (4 . 8)) , (I - 2) + (4 . 9)) , (I - 2) + (4 . 1 0)) , (I - 2) \\
& + (4 . 1 1)) , (I - 2) + (4 . 1 2)) , (I - 2) + (4 . 1 3)) , (I - 2) \\
& + (4 . 1 4)) , (I - 2) + (5 . 1)) , (I - 2) + (5 . 2)) , (I - 2) + (5 \\
& . 3)) , (I - 2) + (5 . 4)) , (I - 2) + (5 . 5)) , (I - 2) + (5 . 6)) , \\
& (I - 2) + (5 . 7)) , (I - 2) + (5 . 8)) , (I - 2) + (5 . 9)) , (I - 2) \\
& + (5 . 1 0)) , (I - 2) + (5 . 1 1)) , (I - 2) + (5 . 1 2)) , (I - 2) \\
& + (5 . 1 3)) , (I - 2) + (5 . 1 4)) , (I - 2) + (5 . 1 5)) , (I - 2) \\
& + (5 . 1 6)) , (I - 2) + (5 . 1 7)) , (I - 2) + (5 . 1 8)) , (I - 2) \\
& + (5 . 1 9)) , (I - 2) + (5 . 2 0)) , (I - 2) + (5 . 2 1)) , (I - 2) \\
& + (5 . 2 2)) , (I - 2) + (5 . 2 3)) , (I - 2) + (5 . 2 4)) , (I - 2) \\
& + (5 . 2 5)) , (I - 2) + (5 . 2 6)) , (I - 2) + (5 . 2 7)) , (I - 2) \\
& + (5 . 2 8)) , (I - 2) + (5 . 2 9)) , (I - 2) + (5 . 3 0)) , (I - 2) \\
& + (5 . 3 1)) , (I - 2) + (5 . 3 2)) , (I - 2) + (5 . 3 3)) , (I - 2) \\
& + (5 . 3 4)) 50
\end{aligned}$$

$(I - 2) + (6.1)$, $(I - 2) + (6.2)$, $(I - 2) + (6.3)$, $(I - 2) + (6.4)$, $(I - 2) + (7.1)$, $(I - 2) + (7.2)$, $(I - 2) + (7.3)$, $(I - 2) + (7.4)$, $(I - 2) + (7.5)$, $(I - 2) + (7.6)$, $(I - 2) + (7.7)$, $(I - 2) + (7.8)$, $(I - 2) + (8.1)$, $(I - 2) + (8.2)$, $(I - 2) + (8.3)$, $(I - 2) + (8.4)$, $(I - 2) + (9.1)$, $(I - 2) + (9.2)$, $(I - 2) + (9.3)$, $(I - 2) + (9.4)$, $(I - 2) + (9.5)$, $(I - 2) + (9.6)$, $(I - 2) + (9.7)$, $(I - 2) + (9.8)$, $(I - 2) + (9.9)$, $(I - 2) + (10.1)$, $(I - 2) + (10.2)$, $(I - 2) + (10.3)$, $(I - 2) + (10.4)$, $(I - 2) + (10.5)$, $(I - 2) + (10.6)$, $(I - 2) + (10.7)$, $(I - 2) + (10.8)$, $(I - 2) + (10.9)$, $(I - 2) + (10.10)$, $(I - 2) + (10.11)$, $(I - 2) + (10.12)$, $(I - 2) + (10.13)$, $(I - 2) + (10.14)$, $(I - 2) + (10.15)$, $(I - 2) + (11.1)$, $(I - 2) + (11.2)$, $(I - 2) + (11.3)$, $(I - 2) + (11.4)$, $(I - 2) + (11.5)$, $(I - 2) + (11.6)$, $(I - 2) + (11.7)$, $(I - 2) + (12.1)$, $(I - 2) + (12.2)$, $(I - 2) + (12.3)$, $(I - 2) + (12.4)$, $(I - 2) + (12.5)$, $(I - 2) + (12.6)$, $(I - 2) + (12.7)$, $(I - 2) + (12.8)$, $(I - 2) + (12.9)$, $(I - 2) + (12.10)$, $(I - 2) + (12.11)$, $(I - 2) + (12.12)$, $(I - 2) + (12.13)$, $(I - 2) + (13.1)$, $(I - 2) + (13.2)$, $(I - 2) + (13.3)$, $(I - 2) + (13.4)$, $(I - 2) + (13.5)$, $(I - 2) + (13.6)$, $(I - 2) + (13.7)$, $(I - 2) + (14.1)$, $(I - 2) + (14.2)$, $(I - 2) + (14.3)$, $(I - 2) + (14.4)$, $(I - 2) + (14.5)$, $(I - 2) + (15.1)$, $(I - 2) + (15.2)$, $(I - 2) + (15.3)$, $(I - 2) + (15.4)$, $(I - 2) + (15.5)$, $(I - 2) + (15.6)$, $(I - 2) + (15.7)$, $(I - 2) + (15.8)$, $(I - 2) + (15.9)$, $(I - 2) + (15.10)$, $(I - 2) + (15.11)$, $(I - 2) + (15.12)$, $(I - 2) + (15.13)$, $(I - 2) + (15.14)$, $(I - 2) + (15.15)$, $(I - 2) + (15.16)$, $(I - 2) + (15.17)$, $(I - 2) + (15.18)$, $(I - 2) + (15.19)$, $(I - 2) + (15.20)$, $(I - 2) + (15.21)$, $(I - 2) + (15.22)$, $(I - 2) + (15.23)$, $(I - 2) + (15.24)$, $(I - 2) + (15.25)$, $(I - 2) + (15.26)$, $(I - 2) + (15.27)$, $(I - 2) + (15.28)$, $(I - 2) + (15.29)$, $(I - 2) + (15.30)$, $(I - 2) + (15.31)$, $(I - 2) + (15.32)$, $(I - 2) + (15.33)$, $(I - 2) + (15.34)$, $(I - 2) + (15.35)$, $(I - 2) + (15.36)$, $(I - 2) + (15.37)$, $(I - 2) + (15.38)$, $(I - 2) + (15.39)$, $(I - 2) + (15.40)$, $(I - 2) + (15.41)$, $(I - 2) + (15.42)$, $(I - 2) + (15.43)$, $(I - 2) + (15.44)$, $(I - 2) + (15.45)$, $(I - 2) + (15.46)$, $(I - 2) + (15.47)$, $(I - 2) + (15.48)$, $(I - 2) + (15.49)$, $(I - 2) + (15.50)$, $(I - 2) + (15.51)$, $(I - 2) + (15.52)$, $(I - 2) + (15.53)$, $(I - 2) + (15.54)$, $(I - 2) + (15.55)$, $(I - 2) + (15.56)$, $(I - 2) + (15.57)$, $(I - 2) + (15.58)$, $(I - 2) + (15.59)$, $(I - 2) + (15.60)$, $(I - 2) + (15.61)$, $(I - 2) + (15.62)$, $(I - 2) + (15.63)$, $(I - 2) + (15.64)$, $(I - 2) + (15.65)$, $(I - 2) + (15.66)$, $(I - 2) + (15.67)$, $(I - 2) + (15.68)$, $(I - 2) + (15.69)$, $(I - 2) + (15.70)$, $(I - 2) + (15.71)$, $(I - 2) + (15.72)$, $(I - 2) + (15.73)$, $(I - 2) + (15.74)$, $(I - 2) + (15.75)$, $(I - 2) + (15.76)$, $(I - 2) + (15.77)$, $(I - 2) + (15.78)$, $(I - 2) + (15.79)$

、(I-2)+(15.80)、(I-2)+(15.81)、(I-2)+(15.82)、(I-2)+(15.83)、(I-2)+(15.84)、(I-2)+(15.85)、(I-2)+(15.86)、(I-2)+(15.87)、(I-2)+(15.88)、(I-2)+(15.89)、(I-2)+(15.90)、(I-2)+(15.91)、(I-2)+(15.92)、(I-2)+(15.93)、(I-2)+(15.94)に関するものである。

【 0 0 3 9 】

別の特に好ましい実施形態において本発明は、式(I)の化合物としての化合物(I-2)および一つの成分(B)を含む混合物、特には混合物(I-2)+(2.1)、(I-2)+(2.2)、(I-2)+(2.6)、(I-2)+(2.8)、(I-2)+(2.11)、(I-2)+(2.12)、(I-2)+(2.13)、(I-2)+(2.14)、(I-2)+(2.15)、(I-2)+(2.16)、(I-2)+(2.17)、(I-2)+(2.29)、(I-2)+(3.1)、(I-2)+(3.2)、(I-2)+(3.3)、(I-2)+(3.4)、(I-2)+(3.9)、(I-2)+(3.10)、(I-2)+(3.12)、(I-2)+(3.16)、(I-2)+(3.17)、(I-2)+(3.22)、(I-2)+(4.6)、(I-2)+(5.1)、(I-2)+(5.4)、(I-2)+(5.5)、(I-2)+(5.7)、(I-2)+(5.8)、(I-2)+(5.9)、(I-2)+(5.16)、(I-2)+(5.23)、(I-2)+(5.25)、(I-2)+(5.26)、(I-2)+(5.29)、(I-2)+(5.30)、(I-2)+(7.7)、(I-2)+(9.2)、(I-2)+(9.4)、(I-2)+(9.5)、(I-2)+(10.9)、(I-2)+(10.10)、(I-2)+(12.9)、(I-2)+(12.10)、(I-2)+(14.4)、(I-2)+(15.9)、(I-2)+(15.24)、(I-2)+(15.25)、(I-2)+(15.26)、(I-2)+(15.41)、(I-2)+(15.42)、(I-2)+(15.54)、(I-2)+(15.55)、(I-2)+(15.56)、(I-2)+(15.60)、(I-2)+(15.90)に関するものである。

【 0 0 4 0 】

12.1)、(I-3)+(12.2)、(I-3)+(12.3)、(I-3)+(12.4)、(I-3)+(12.5)、(I-3)+(12.6)、(I-3)+(12.7)、(I-3)+(12.8)、(I-3)+(12.9)、(I-3)+(12.10)、(I-3)+(12.11)、(I-3)+(12.12)、(I-3)+(12.13)、(I-3)+(13.1)、(I-3)+(13.2)、(I-3)+(13.3)、(I-3)+(13.4)、(I-3)+(13.5)、(I-3)+(13.6)、(I-3)+(13.7)、(I-3)+(14.1)、(I-3)+(14.2)、(I-3)+(14.3)、(I-3)+(14.4)、(I-3)+(14.5)、(I-3)+(15.1)、(I-3)+(15.2)、(I-3)+(15.3)、(I-3)+(15.4)、(I-3)+(15.5)、(I-3)+(15.6)、(I-3)+(15.7)、(I-3)+(15.8)、(I-3)+(15.9)、(I-3)+(15.10)、(I-3)+(15.11)、(I-3)+(15.12)、(I-3)+(15.13)、(I-3)+(15.14)、(I-3)+(15.15)、(I-3)+(15.16)、(I-3)+(15.17)、(I-3)+(15.18)、(I-3)+(15.19)、(I-3)+(15.20)、(I-3)+(15.21)、(I-3)+(15.22)、(I-3)+(15.23)、(I-3)+(15.24)、(I-3)+(15.25)、(I-3)+(15.26)、(I-3)+(15.27)、(I-3)+(15.28)、(I-3)+(15.29)、(I-3)+(15.30)、(I-3)+(15.31)、(I-3)+(15.32)、(I-3)+(15.33)、(I-3)+(15.34)、(I-3)+(15.35)、(I-3)+(15.36)、(I-3)+(15.37)、(I-3)+(15.38)、(I-3)+(15.39)、(I-3)+(15.40)、(I-3)+(15.41)、(I-3)+(15.42)、(I-3)+(15.43)、(I-3)+(15.44)、(I-3)+(15.45)、(I-3)+(15.46)、(I-3)+(15.47)、(I-3)+(15.48)、(I-3)+(15.49)、(I-3)+(15.50)、(I-3)+(15.51)、(I-3)+(15.52)、(I-3)+(15.53)、(I-3)+(15.54)、(I-3)+(15.55)、(I-3)+(15.56)、(I-3)+(15.57)、(I-3)+(15.58)、(I-3)+(15.59)、(I-3)+(15.60)、(I-3)+(15.61)、(I-3)+(15.62)、(I-3)+(15.63)、(I-3)+(15.64)、(I-3)+(15.65)、(I-3)+(15.66)、(I-3)+(15.67)、(I-3)+(15.68)、(I-3)+(15.69)、(I-3)+(15.70)、(I-3)+(15.71)、(I-3)+(15.72)、(I-3)+(15.73)、(I-3)+(15.74)、(I-3)+(15.75)、(I-3)+(15.76)、(I-3)+(15.77)、(I-3)+(15.78)、(I-3)+(15.79)、(I-3)+(15.80)、(I-3)+(15.81)、(I-3)+(15.82)、(I-3)+(15.83)、(I-3)+(15.84)、(I-3)+(15.85)、(I-3)+(15.86)、(I-3)+(15.87)、(I-3)+(15.88)、(I-3)+(15.89)、(I-3)+(15.90)、(I-3)+(15.91)、(I-3)+(15.92)、(I-3)+(15.93)、(I-3)+(15.94)に関するものである。

【0041】

別の特に好ましい実施形態において本発明は、式(I)の化合物としての化合物(I-3)および一つの成分(B)を含む混合物、特には混合物(I-3)+(2.1)、(I-3)+(2.2)、(I-3)+(2.6)、(I-3)+(2.8)、(I-3)+(2.11)、(I-3)+(2.12)、(I-3)+(2.13)、(I-3)+(2.14)、(I-3)+(2.15)、(I-3)+(2.16)、(I-3)+(2.17)、(I-3)+(2.29)、(I-3)+(3.1)、(I-3)+(3.2)、(I-3)+(3.3)、(I-3)+(3.4)、(I-3)+(3.9)、(I-3)+(3.10)、(I-3)+(3.12)、(I-3)+(3.16)、(I-3)+(3.17)、(I-3)+(3.18)、(I-3)+(3.19)、(I-3)+(3.20)、(I-3)+(3.21)、(I-3)+(3.22)、(I-3)+(3.23)、(I-3)+(3.24)、(I-3)+(3.25)、(I-3)+(3.26)、(I-3)+(3.27)、(I-3)+(3.28)、(I-3)+(3.29)、(I-3)+(3.30)、(I-3)+(3.31)、(I-3)+(3.32)、(I-3)+(3.33)、(I-3)+(3.34)、(I-3)+(3.35)、(I-3)+(3.36)、(I-3)+(3.37)、(I-3)+(3.38)、(I-3)+(3.39)、(I-3)+(3.40)、(I-3)+(3.41)、(I-3)+(3.42)、(I-3)+(3.43)、(I-3)+(3.44)、(I-3)+(3.45)、(I-3)+(3.46)、(I-3)+(3.47)、(I-3)+(3.48)、(I-3)+(3.49)、(I-3)+(3.50)、(I-3)+(3.51)、(I-3)+(3.52)、(I-3)+(3.53)、(I-3)+(3.54)、(I-3)+(3.55)、(I-3)+(3.56)、(I-3)+(3.57)、(I-3)+(3.58)、(I-3)+(3.59)、(I-3)+(3.60)、(I-3)+(3.61)、(I-3)+(3.62)、(I-3)+(3.63)、(I-3)+(3.64)、(I-3)+(3.65)、(I-3)+(3.66)、(I-3)+(3.67)、(I-3)+(3.68)、(I-3)+(3.69)、(I-3)+(3.70)、(I-3)+(3.71)、(I-3)+(3.72)、(I-3)+(3.73)、(I-3)+(3.74)、(I-3)+(3.75)、(I-3)+(3.76)、(I-3)+(3.77)、(I-3)+(3.78)、(I-3)+(3.79)、(I-3)+(3.80)、(I-3)+(3.81)、(I-3)+(3.82)、(I-3)+(3.83)、(I-3)+(3.84)、(I-3)+(3.85)、(I-3)+(3.86)、(I-3)+(3.87)、(I-3)+(3.88)、(I-3)+(3.89)、(I-3)+(3.90)、(I-3)+(3.91)、(I-3)+(3.92)、(I-3)+(3.93)、(I-3)+(3.94)に関するものである。

3) + (3 . 1 7) 、 (I - 3) + (3 . 2 2) 、 (I - 3) + (4 . 6) 、 (I - 3) + (5 . 1) 、 (I - 3) + (5 . 4) 、 (I - 3) + (5 . 5) 、 (I - 3) + (5 . 7) 、 (I - 3) + (5 . 8) 、 (I - 3) + (5 . 9) 、 (I - 3) + (5 . 1 6) 、 (I - 3) + (5 . 2 3) 、 (I - 3) + (5 . 2 5) 、 (I - 3) + (5 . 2 6) 、 (I - 3) + (5 . 2 9) 、 (I - 3) + (5 . 3 0) 、 (I - 3) + (7 . 7) 、 (I - 3) + (9 . 2) 、 (I - 3) + (9 . 4) 、 (I - 3) + (9 . 5) 、 (I - 3) + (1 0 . 9) 、 (I - 3) + (1 0 . 1 0) 、 (I - 3) + (1 2 . 9) 、 (I - 3) + (1 2 . 1 0) 、 (I - 3) + (1 4 . 4) 、 (I - 3) + (1 5 . 9) 、 (I - 3) + (1 5 . 2 4) 、 (I - 3) + (1 5 . 2 5) 、 (I - 3) + (1 5 . 2 6) 、 (I - 3) + (1 5 . 4 1) 、 (I - 3) + (1 5 . 4 2) 、 (I - 3) + (1 5 . 5 4) 、 (I - 3) + (1 5 . 5 5) 、 (I - 3) + (1 5 . 5 6) 、 (I - 3) + (1 5 . 6 0) 、 (I - 3) + (1 5 . 9 0) に関するものである。 10

(1 5 . 2 4) 、 (I - 4) + (1 5 . 2 5) 、 (I - 4) + (1 5 . 2 6) 、 (I - 4) + (1 5 . 2 7) 、 (I - 4) + (1 5 . 2 8) 、 (I - 4) + (1 5 . 2 9) 、 (I - 4) + (1 5 . 3 0) 、 (I - 4) + (1 5 . 3 1) 、 (I - 4) + (1 5 . 3 2) 、 (I - 4) + (1 5 . 3 3) 、 (I - 4) + (1 5 . 3 4) 、 (I - 4) + (1 5 . 3 5) 、 (I - 4) + (1 5 . 3 6) 、 (I - 4) + (1 5 . 3 7) 、 (I - 4) + (1 5 . 3 8) 、 (I - 4) + (1 5 . 3 9) 、 (I - 4) + (1 5 . 4 1) 、 (I - 4) + (1 5 . 4 2) 、 (I - 4) + (1 5 . 4 3) 、 (I - 4) + (1 5 . 4 4) 、 (I - 4) + (1 5 . 4 5) 、 (I - 4) + (1 5 . 4 6) 、 (I - 4) + (1 5 . 4 7) 、 (I - 4) + (1 5 . 4 8) 、 (I - 4) + (1 5 . 4 9) 、 (I - 4) + (1 5 . 5 0) 、 (I - 4) + (1 5 . 5 1) 、 (I - 4) + (1 5 . 5 2) 、 (I - 4) + (1 5 . 5 3) 、 (I - 4) + (1 5 . 5 4) 、 (I - 4) + (1 5 . 5 5) 、 (I - 4) + (1 5 . 5 6) 、 (I - 4) + (1 5 . 5 7) 、 (I - 4) + (1 5 . 5 8) 、 (I - 4) + (1 5 . 5 9) 、 (I - 4) + (1 5 . 6 0) 、 (I - 4) + (1 5 . 6 1) 、 (I - 4) + (1 5 . 6 2) 、 (I - 4) + (1 5 . 6 3) 、 (I - 4) + (1 5 . 6 4) 、 (I - 4) + (1 5 . 6 5) 、 (I - 4) + (1 5 . 6 6) 、 (I - 4) + (1 5 . 6 7) 、 (I - 4) + (1 5 . 6 8) 、 (I - 4) + (1 5 . 6 9) 、 (I - 4) + (1 5 . 7 0) 、 (I - 4) + (1 5 . 7 1) 、 (I - 4) + (1 5 . 7 2) 、 (I - 4) + (1 5 . 7 3) 、 (I - 4) + (1 5 . 7 4) 、 (I - 4) + (1 5 . 7 5) 、 (I - 4) + (1 5 . 7 6) 、 (I - 4) + (1 5 . 7 7) 、 (I - 4) + (1 5 . 7 8) 、 (I - 4) + (1 5 . 7 9) 、 (I - 4) + (1 5 . 8 0) 、 (I - 4) + (1 5 . 8 1) 、 (I - 4) + (1 5 . 8 2) 、 (I - 4) + (1 5 . 8 3) 、 (I - 4) + (1 5 . 8 4) 、 (I - 4) + (1 5 . 8 5) 、 (I - 4) + (1 5 . 8 6) 、 (I - 4) + (1 5 . 8 7) 、 (I - 4) + (1 5 . 8 8) 、 (I - 4) + (1 5 . 8 9) 、 (I - 4) + (1 5 . 9 0) 、 (I - 4) + (1 5 . 9 1) 、 (I - 4) + (1 5 . 9 2) 、 (I - 4) + (1 5 . 9 3) 、 (I - 4) + (1 5 . 9 4) に関するものである。

【 0 0 4 2 】

別の特に好ましい実施形態において本発明は、式(I)の化合物としての化合物(I-4)および一つの成分(B)を含む混合物、特に混合物(I-4)+(2.1)、(I-4)+(2.4)+(2.2)、(I-4)+(2.6)、(I-4)+(2.8)、(I-4)+(2.11)、(I-4)+(2.12)、(I-4)+(2.13)、(I-4)+(2.14)、(I-4)+(2.15)、(I-4)+(2.16)、(I-4)+(2.17)、(I-4)+(2.29)、(I-4)+(3.1)、(I-4)+(3.2)、(I-4)+(3.3)、(I-4)+(3.4)、(I-4)+(3.9)、(I-4)+(3.10)、(I-4)+(3.12)、(I-4)+(3.16)、(I-4)+(3.17)、(I-4)+(3.22)、(I-4)+(4.6)、(I-4)+(5.1)、(I-4)+(5.4)、(I-4)+(5.5)、(I-4)+(5.7)、(I-4)+(5.8)、(I-4)+(5.9)、(I-4)+(5.16)、(I-4)+(5.23)、(I-4)+(5.25)、(I-4)+(5.26)、(I-4)+(5.29)、(I-4)+(5.30)、(I-4)+(7.7)、(I-4)+(9.2)、(I-4)+(9.4)、(I-4)+(9.5)、(I-4)+(10.9)、(I-4)+(10.10)、(I-4)+(12.9)、(I-4)+(12.10)、(I-4)+(14.4)、(I-4)+(15.9)、(I-4)+(15.24)、(I-4)+(15.25)、(I-4)+(15.26)、(I-4)+(15.41)、(I-4)+(15.42)、(I-4)+(15.54)、(I-4)+(15.55)、(I-4)+(15.56)、(I-4)+(15.60)、(I-4)+(15.90)に関するものである。
30
40

〔 0 0 4 3 〕

ある好ましい実施形態において本発明は、式(Ⅰ)の化合物としての化合物(Ⅰ-5)および一つの成分(B)を含む混合物、特に混合物(Ⅰ-5)+(1.1)、(Ⅰ-5)+(1.2)、(Ⅰ-5)+(1.3)、(Ⅰ-5)+(1.4)、(Ⅰ-5)+(1.5)50

.
 5)、(I - 5) + (1 . 6)、(I - 5) + (1 . 7)、(I - 5) + (1 . 8)、
 (I - 5) + (1 . 9)、(I - 5) + (1 . 10)、(I - 5) + (1 . 11)、(I
 - 5) + (1 . 12)、(I - 5) + (1 . 13)、(I - 5) + (1 . 14)、(I -
 5) + (1 . 15)、(I - 5) + (1 . 16)、(I - 5) + (1 . 17)、(I - 5
) + (1 . 18)、(I - 5) + (1 . 19)、(I - 5) + (1 . 20)、(I - 5)
 + (1 . 21)、(I - 5) + (1 . 22)、(I - 5) + (1 . 23)、(I - 5) +
 (1 . 24)、(I - 5) + (1 . 25)、(I - 5) + (1 . 26)、(I - 5) + (1
 . 27)、(I - 5) + (1 . 28)、(I - 5) + (1 . 29)、(I - 5) + (1
 . 30)、(I - 5) + (1 . 31)、(I - 5) + (1 . 32)、(I - 5) + (1
 . 33)、(I - 5) + (1 . 34)、(I - 5) + (1 . 35)、(I - 5) + (1 . 3
 6)、(I - 5) + (1 . 37)、(I - 5) + (1 . 38)、(I - 5) + (1 . 39
)、(I - 5) + (1 . 40)、(I - 5) + (1 . 41)、(I - 5) + (1 . 42)
 10 (I - 5) + (1 . 43)、(I - 5) + (1 . 44)、(I - 5) + (1 . 45)、
 (I - 5) + (1 . 46)、(I - 5) + (1 . 47)、(I - 5) + (1 . 48)、(I
 - 5) + (1 . 49)、(I - 5) + (1 . 50)、(I - 5) + (1 . 51)、(I
 - 5) + (1 . 52)、(I - 5) + (1 . 53)、(I - 5) + (1 . 54)、(I
 - 5) + (1 . 55)、(I - 5) + (1 . 56)、(I - 5) + (1 . 57)、(I - 5
) + (1 . 58)、(I - 5) + (1 . 59)、(I - 5) + (1 . 60)、(I - 5)
 + (1 . 61)、(I - 5) + (1 . 62)、(I - 5) + (1 . 63)、(I - 5) +
 (1 . 64)、(I - 5) + (2 . 1)、(I - 5) + (2 . 2)、(I - 5) + (2 .
 20 3)、(I - 5) + (2 . 4)、(I - 5) + (2 . 5)、(I - 5) + (2 . 6)、(I
 - 5) + (2 . 7)、(I - 5) + (2 . 8)、(I - 5) + (2 . 9)、(I - 5)
 + (2 . 10)、(I - 5) + (2 . 11)、(I - 5) + (2 . 12)、(I - 5) +
 (2 . 13)、(I - 5) + (2 . 14)、(I - 5) + (2 . 15)、(I - 5) + (2
 . 16)、(I - 5) + (2 . 17)、(I - 5) + (2 . 18)、(I - 5) + (2
 . 19)、(I - 5) + (2 . 20)、(I - 5) + (2 . 21)、(I - 5) + (2
 . 22)、(I - 5) + (2 . 23)、(I - 5) + (2 . 24)、(I - 5) + (2 . 2
 5)、(I - 5) + (2 . 26)、(I - 5) + (2 . 27)、(I - 5) + (2 . 28
)、(I - 5) + (2 . 29)、(I - 5) + (3 . 1)、(I - 5) + (3 . 2)、(I
 - 5) + (3 . 3)、(I - 5) + (3 . 4)、(I - 5) + (3 . 5)、(I - 5)
 30 + (3 . 6)、(I - 5) + (3 . 7)、(I - 5) + (3 . 8)、(I - 5) + (3 .
 9)、(I - 5) + (3 . 10)、(I - 5) + (3 . 11)、(I - 5) + (3 . 12)
)、(I - 5) + (3 . 13)、(I - 5) + (3 . 14)、(I - 5) + (3 . 15)
 、(I - 5) + (3 . 16)、(I - 5) + (3 . 17)、(I - 5) + (3 . 18)
 、(I - 5) + (3 . 19)、(I - 5) + (3 . 20)、(I - 5) + (3 . 21)、(I
 - 5) + (3 . 22)、(I - 5) + (3 . 23)、(I - 5) + (3 . 24)、(I
 - 5) + (3 . 25)、(I - 5) + (3 . 26)、(I - 5) + (3 . 27)、(I -
 5) + (3 . 28)、(I - 5) + (3 . 29)、(I - 5) + (3 . 30)、(I - 5)
 + (3 . 31)、(I - 5) + (3 . 32)、(I - 5) + (3 . 33)、(I - 5)
 + (4 . 1)、(I - 5) + (4 . 2)、(I - 5) + (4 . 3)、(I - 5) + (4 .
 40 4)、(I - 5) + (4 . 5)、(I - 5) + (4 . 6)、(I - 5) + (4 . 7)、(I
 - 5) + (4 . 8)、(I - 5) + (4 . 9)、(I - 5) + (4 . 10)、(I - 5)
 + (4 . 11)、(I - 5) + (4 . 12)、(I - 5) + (4 . 13)、(I - 5)
 + (4 . 14)、(I - 5) + (5 . 1)、(I - 5) + (5 . 2)、(I - 5) + (5
 . 3)、(I - 5) + (5 . 4)、(I - 5) + (5 . 5)、(I - 5) + (5 . 6)、
 (I - 5) + (5 . 7)、(I - 5) + (5 . 8)、(I - 5) + (5 . 9)、(I - 5)
 + (5 . 10)、(I - 5) + (5 . 11)、(I - 5) + (5 . 12)、(I - 5)
 + (5 . 13)、(I - 5) + (5 . 14)、(I - 5) + (5 . 15)、(I - 5) +
 (5 . 16)、(I - 5) + (5 . 17)、(I - 5) + (5 . 18)、(I - 5) + (5
 . 19)、(I - 5) + (5 . 20)、(I - 5) + (5 . 21)、(I - 5) + (5
 50)

5) + (1 5 . 6 8) 、 (I - 5) + (1 5 . 6 9) 、 (I - 5) + (1 5 . 7 0) 、 (I - 5) + (1 5 . 7 1) 、 (I - 5) + (1 5 . 7 2) 、 (I - 5) + (1 5 . 7 3) 、 (I - 5) + (1 5 . 7 4) 、 (I - 5) + (1 5 . 7 5) 、 (I - 5) + (1 5 . 7 6) 、 (I - 5) + (1 5 . 7 7) 、 (I - 5) + (1 5 . 7 8) 、 (I - 5) + (1 5 . 7 9) 、 (I - 5) + (1 5 . 8 0) 、 (I - 5) + (1 5 . 8 1) 、 (I - 5) + (1 5 . 8 2) 、 (I - 5) + (1 5 . 8 3) 、 (I - 5) + (1 5 . 8 4) 、 (I - 5) + (1 5 . 8 5) 、 (I - 5) + (1 5 . 8 6) 、 (I - 5) + (1 5 . 8 7) 、 (I - 5) + (1 5 . 8 8) 、 (I - 5) + (1 5 . 8 9) 、 (I - 5) + (1 5 . 9 0) 、 (I - 5) + (1 5 . 9 1) 、 (I - 5) + (1 5 . 9 2) 、 (I - 5) + (1 5 . 9 3) 、 (I - 5) + (1 5 . 9 4) に関するものである。 10

【 0 0 4 4 】

別の特に好ましい実施形態において本発明は、式 (I) の化合物としての化合物 (I - 5) および一つの成分 (B) を含む混合物、特には混合物 (I - 5) + (2 . 1) 、 (I - 5) + (2 . 2) 、 (I - 5) + (2 . 6) 、 (I - 5) + (2 . 8) 、 (I - 5) + (2 . 1 1) 、 (I - 5) + (2 . 1 2) 、 (I - 5) + (2 . 1 3) 、 (I - 5) + (2 . 1 4) 、 (I - 5) + (2 . 1 5) 、 (I - 5) + (2 . 1 6) 、 (I - 5) + (2 . 1 7) 、 (I - 5) + (2 . 2 9) 、 (I - 5) + (3 . 1) 、 (I - 5) + (3 . 2) 、 (I - 5) + (3 . 3) 、 (I - 5) + (3 . 4) 、 (I - 5) + (3 . 9) 、 (I - 5) + (3 . 1 0) 、 (I - 5) + (3 . 1 2) 、 (I - 5) + (3 . 1 6) 、 (I - 5) + (3 . 1 7) 、 (I - 5) + (3 . 2 2) 、 (I - 5) + (4 . 6) 、 (I - 5) + (5 . 1) 、 (I - 5) + (5 . 4) 、 (I - 5) + (5 . 5) 、 (I - 5) + (5 . 7) 、 (I - 5) + (5 . 8) 、 (I - 5) + (5 . 9) 、 (I - 5) + (5 . 1 6) 、 (I - 5) + (5 . 2 3) 、 (I - 5) + (5 . 2 5) 、 (I - 5) + (5 . 2 6) 、 (I - 5) + (5 . 2 9) 、 (I - 5) + (5 . 3 0) 、 (I - 5) + (7 . 7) 、 (I - 5) + (9 . 2) 、 (I - 5) + (9 . 4) 、 (I - 5) + (9 . 5) 、 (I - 5) + (1 0 . 9) 、 (I - 5) + (1 0 . 1 0) 、 (I - 5) + (1 2 . 9) 、 (I - 5) + (1 2 . 1 0) 、 (I - 5) + (1 4 . 4) 、 (I - 5) + (1 5 . 9) 、 (I - 5) + (1 5 . 2 4) 、 (I - 5) + (1 5 . 2 5) 、 (I - 5) + (1 5 . 2 6) 、 (I - 5) + (1 5 . 4 1) 、 (I - 5) + (1 5 . 4 2) 、 (I - 5) + (1 5 . 5 4) 、 (I - 5) + (1 5 . 5 5) 、 (I - 5) + (1 5 . 5 6) 、 (I - 5) + (1 5 . 6 0) 、 (I - 5) + (1 5 . 9 0) に関するものである。 20 30

【 0 0 4 5 】

ある好ましい実施形態において本発明は、式 (I) の化合物としての化合物 (I - 6) および一つの成分 (B) を含む混合物、特には混合物 (I - 6) + (1 . 1) 、 (I - 6) + (1 . 2) 、 (I - 6) + (1 . 3) 、 (I - 6) + (1 . 4) 、 (I - 6) + (1 . 5) 、 (I - 6) + (1 . 6) 、 (I - 6) + (1 . 7) 、 (I - 6) + (1 . 8) 、 (I - 6) + (1 . 9) 、 (I - 6) + (1 . 1 0) 、 (I - 6) + (1 . 1 1) 、 (I - 6) + (1 . 1 2) 、 (I - 6) + (1 . 1 3) 、 (I - 6) + (1 . 1 4) 、 (I - 6) + (1 . 1 5) 、 (I - 6) + (1 . 1 6) 、 (I - 6) + (1 . 1 7) 、 (I - 6) + (1 . 1 8) 、 (I - 6) + (1 . 1 9) 、 (I - 6) + (1 . 2 0) 、 (I - 6) + (1 . 2 1) 、 (I - 6) + (1 . 2 2) 、 (I - 6) + (1 . 2 3) 、 (I - 6) + (1 . 2 4) 、 (I - 6) + (1 . 2 5) 、 (I - 6) + (1 . 2 6) 、 (I - 6) + (1 . 2 7) 、 (I - 6) + (1 . 2 8) 、 (I - 6) + (1 . 2 9) 、 (I - 6) + (1 . 3 0) 、 (I - 6) + (1 . 3 1) 、 (I - 6) + (1 . 3 2) 、 (I - 6) + (1 . 3 3) 、 (I - 6) + (1 . 3 4) 、 (I - 6) + (1 . 3 5) 、 (I - 6) + (1 . 3 6) 、 (I - 6) + (1 . 3 7) 、 (I - 6) + (1 . 3 8) 、 (I - 6) + (1 . 3 9) 、 (I - 6) + (1 . 4 0) 、 (I - 6) + (1 . 4 1) 、 (I - 6) + (1 . 4 2) 、 (I - 6) + (1 . 4 3) 、 (I - 6) + (1 . 4 4) 、 (I - 6) + (1 . 4 5) 、 (I - 6) + (1 . 4 6) 、 (I - 6) + (1 . 4 7) 、 (I - 6) + (1 . 4 8) 、 (I - 6) + (1 . 4 9) 、 (I - 6) + (1 . 5 0) 、 (I - 6) + (1 . 5 1) 、 (I - 6) + (1 . 5 2) 50

0 . 1 1) 、 (I - 6) + (1 0 . 1 2) 、 (I - 6) + (1 0 . 1 3) 、 (I - 6) + (1 0 . 1 4) 、 (I - 6) + (1 0 . 1 5) 、 (I - 6) + (1 1 . 1) 、 (I - 6) + (1 1 . 2) 、 (I - 6) + (1 1 . 3) 、 (I - 6) + (1 1 . 4) 、 (I - 6) + (1 1 . 5) 、 (I - 6) + (1 1 . 6) 、 (I - 6) + (1 1 . 7) 、 (I - 6) + (1 2 . 1) 、 (I - 6) + (1 2 . 2) 、 (I - 6) + (1 2 . 3) 、 (I - 6) + (1 2 . 4) 、 (I - 6) + (1 2 . 5) 、 (I - 6) + (1 2 . 6) 、 (I - 6) + (1 2 . 7) 、 (I - 6) + (1 2 . 8) 、 (I - 6) + (1 2 . 9) 、 (I - 6) + (1 2 . 1 0) 、 (I - 6) + (1 2 . 1 1) 、 (I - 6) + (1 2 . 1 2) 、 (I - 6) + (1 2 . 1 3) 、 (I - 6) + (1 3 . 1) 、 (I - 6) + (1 3 . 2) 、 (I - 6) + (1 3 . 3) 、 (I - 6) + (1 3 . 4) 、 (I - 6) + (1 3 . 5) 、 (I - 6) + (1 3 . 6) 、 (I - 6) + (1 3 . 7) 、 (I - 6) + (1 4 . 1) 、 (I - 6) + (1 4 . 2) 、 (I - 6) + (1 4 . 3) 、 (I - 6) + (1 4 . 4) 、 (I - 6) + (1 4 . 5) 、 (I - 6) + (1 5 . 1) 、 (I - 6) + (1 5 . 2) 、 (I - 6) + (1 5 . 3) 、 (I - 6) + (1 5 . 4) 、 (I - 6) + (1 5 . 5) 、 (I - 6) + (1 5 . 6) 、 (I - 6) + (1 5 . 7) 、 (I - 6) + (1 5 . 8) 、 (I - 6) + (1 5 . 9) 、 (I - 6) + (1 5 . 1 0) 、 (I - 6) + (1 5 . 1 1) 、 (I - 6) + (1 5 . 1 2) 、 (I - 6) + (1 5 . 1 3) 、 (I - 6) + (1 5 . 1 4) 、 (I - 6) + (1 5 . 1 5) 、 (I - 6) + (1 5 . 1 6) 、 (I - 6) + (1 5 . 1 7) 、 (I - 6) + (1 5 . 1 8) 、 (I - 6) + (1 5 . 1 9) 、 (I - 6) + (1 5 . 2 0) 、 (I - 6) + (1 5 . 2 1) 、 (I - 6) + (1 5 . 2 2) 、 (I - 6) + (1 5 . 2 3) 、 (I - 6) + (1 5 . 2 4) 、 (I - 6) + (1 5 . 2 5) 、 (I - 6) + (1 5 . 2 6) 、 (I - 6) + (1 5 . 2 7) 、 (I - 6) + (1 5 . 2 8) 、 (I - 6) + (1 5 . 2 9) 、 (I - 6) + (1 5 . 3 0) 、 (I - 6) + (1 5 . 3 1) 、 (I - 6) + (1 5 . 3 2) 、 (I - 6) + (1 5 . 3 3) 、 (I - 6) + (1 5 . 3 4) 、 (I - 6) + (1 5 . 3 5) 、 (I - 6) + (1 5 . 3 6) 、 (I - 6) + (1 5 . 3 7) 、 (I - 6) + (1 5 . 3 8) 、 (I - 6) + (1 5 . 3 9) 、 (I - 6) + (1 5 . 4 1) 、 (I - 6) + (1 5 . 4 2) 、 (I - 6) + (1 5 . 4 3) 、 (I - 6) + (1 5 . 4 4) 、 (I - 6) + (1 5 . 4 5) 、 (I - 6) + (1 5 . 4 6) 、 (I - 6) + (1 5 . 4 7) 、 (I - 6) + (1 5 . 4 8) 、 (I - 6) + (1 5 . 4 9) 、 (I - 6) + (1 5 . 5 0) 、 (I - 6) + (1 5 . 5 1) 、 (I - 6) + (1 5 . 5 2) 、 (I - 6) + (1 5 . 5 3) 、 (I - 6) + (1 5 . 5 4) 、 (I - 6) + (1 5 . 5 5) 、 (I - 6) + (1 5 . 5 6) 、 (I - 6) + (1 5 . 5 7) 、 (I - 6) + (1 5 . 5 8) 、 (I - 6) + (1 5 . 5 9) 、 (I - 6) + (1 5 . 6 0) 、 (I - 6) + (1 5 . 6 1) 、 (I - 6) + (1 5 . 6 2) 、 (I - 6) + (1 5 . 6 3) 、 (I - 6) + (1 5 . 6 4) 、 (I - 6) + (1 5 . 6 5) 、 (I - 6) + (1 5 . 6 6) 、 (I - 6) + (1 5 . 6 7) 、 (I - 6) + (1 5 . 6 8) 、 (I - 6) + (1 5 . 6 9) 、 (I - 6) + (1 5 . 7 0) 、 (I - 6) + (1 5 . 7 1) 、 (I - 6) + (1 5 . 7 2) 、 (I - 6) + (1 5 . 7 3) 、 (I - 6) + (1 5 . 7 4) 、 (I - 6) + (1 5 . 7 5) 、 (I - 6) + (1 5 . 7 6) 、 (I - 6) + (1 5 . 7 7) 、 (I - 6) + (1 5 . 7 8) 、 (I - 6) + (1 5 . 7 9) 、 (I - 6) + (1 5 . 8 0) 、 (I - 6) + (1 5 . 8 1) 、 (I - 6) + (1 5 . 8 2) 、 (I - 6) + (1 5 . 8 3) 、 (I - 6) + (1 5 . 8 4) 、 (I - 6) + (1 5 . 8 5) 、 (I - 6) + (1 5 . 8 6) 、 (I - 6) + (1 5 . 8 7) 、 (I - 6) + (1 5 . 8 8) 、 (I - 6) + (1 5 . 8 9) 、 (I - 6) + (1 5 . 9 0) 、 (I - 6) + (1 5 . 9 1) 、 (I - 6) + (1 5 . 9 2) 、 (I - 6) + (1 5 . 9 3) 、 (I - 6) + (1 5 . 9 4) に 関するものである。

【 0 0 4 6 】

別の特に好ましい実施形態において本発明は、式 (I) の化合物としての化合物 (I - 6) および一つの成分 (B) を含む混合物、特には混合物 (I - 6) + (2 . 1) 、 (I - 6) + (2 . 2) 、 (I - 6) + (2 . 6) 、 (I - 6) + (2 . 8) 、 (I - 6) + (2 . 1 1) 、 (I - 6) + (2 . 1 2) 、 (I - 6) + (2 . 1 3) 、 (I - 6) + (10)

2 . 1 4) 、 (I - 6) + (2 . 1 5) 、 (I - 6) + (2 . 1 6) 、 (I - 6) + (2 . 1 7) 、 (I - 6) + (2 . 2 9) 、 (I - 6) + (3 . 1) 、 (I - 6) + (3 . 2) 、 (I - 6) + (3 . 3) 、 (I - 6) + (3 . 4) 、 (I - 6) + (3 . 9) 、 (I - 6) + (3 . 1 0) 、 (I - 6) + (3 . 1 2) 、 (I - 6) + (3 . 1 6) 、 (I - 6) + (3 . 1 7) 、 (I - 6) + (3 . 2 2) 、 (I - 6) + (4 . 6) 、 (I - 6) + (5 . 1) 、 (I - 6) + (5 . 4) 、 (I - 6) + (5 . 5) 、 (I - 6) + (5 . 7) 、 (I - 6) + (5 . 8) 、 (I - 6) + (5 . 9) 、 (I - 6) + (5 . 1 6) 、 (I - 6) + (5 . 2 3) 、 (I - 6) + (5 . 2 5) 、 (I - 6) + (5 . 2 6) 、 (I - 6) + (5 . 2 9) 、 (I - 6) + (5 . 3 0) 、 (I - 6) + (7 . 7) 、 (I - 6) + (9 . 2) 、 (I - 6) + (9 . 4) 、 (I - 6) + (9 . 5) 、 (I - 6) + (1 0 . 9) 、 (I - 6) + (1 0 . 1 0) 、 (I - 6) + (1 2 . 9) 、 (I - 6) + (1 2 . 1 0) 、 (I - 6) + (1 4 . 4) 、 (I - 6) + (1 5 . 9) 、 (I - 6) + (1 5 . 2 4) 、 (I - 6) + (1 5 . 2 5) 、 (I - 6) + (1 5 . 2 6) 、 (I - 6) + (1 5 . 4 1) 、 (I - 6) + (1 5 . 4 2) 、 (I - 6) + (1 5 . 5 4) 、 (I - 6) + (1 5 . 5 5) 、 (I - 6) + (1 5 . 5 6) 、 (I - 6) + (1 5 . 6 0) 、 (I - 6) + (1 5 . 9 0) に関するものである。
 【0047】

ある好ましい実施形態において本発明は、式(I)の化合物としての化合物(I - 7)および一つの成分(B)を含む混合物、特には混合物(I - 7) + (1 . 1)、(I - 7) + (1 . 2)、(I - 7) + (1 . 3)、(I - 7) + (1 . 4)、(I - 7) + (1 . 5)、(I - 7) + (1 . 6)、(I - 7) + (1 . 7)、(I - 7) + (1 . 8)、(I - 7) + (1 . 9)、(I - 7) + (1 . 1 0)、(I - 7) + (1 . 1 1)、(I - 7) + (1 . 1 2)、(I - 7) + (1 . 1 3)、(I - 7) + (1 . 1 4)、(I - 7) + (1 . 1 5)、(I - 7) + (1 . 1 6)、(I - 7) + (1 . 1 7)、(I - 7) + (1 . 1 8)、(I - 7) + (1 . 1 9)、(I - 7) + (1 . 2 0)、(I - 7) + (1 . 2 1)、(I - 7) + (1 . 2 2)、(I - 7) + (1 . 2 3)、(I - 7) + (1 . 2 4)、(I - 7) + (1 . 2 5)、(I - 7) + (1 . 2 6)、(I - 7) + (1 . 2 7)、(I - 7) + (1 . 2 8)、(I - 7) + (1 . 2 9)、(I - 7) + (1 . 3 0)、(I - 7) + (1 . 3 1)、(I - 7) + (1 . 3 2)、(I - 7) + (1 . 3 3)、(I - 7) + (1 . 3 4)、(I - 7) + (1 . 3 5)、(I - 7) + (1 . 3 6)、(I - 7) + (1 . 3 7)、(I - 7) + (1 . 3 8)、(I - 7) + (1 . 3 9)、(I - 7) + (1 . 4 0)、(I - 7) + (1 . 4 1)、(I - 7) + (1 . 4 2)、(I - 7) + (1 . 4 3)、(I - 7) + (1 . 4 4)、(I - 7) + (1 . 4 5)、(I - 7) + (1 . 4 6)、(I - 7) + (1 . 4 7)、(I - 7) + (1 . 4 8)、(I - 7) + (1 . 4 9)、(I - 7) + (1 . 5 0)、(I - 7) + (1 . 5 1)、(I - 7) + (1 . 5 2)、(I - 7) + (1 . 5 3)、(I - 7) + (1 . 5 4)、(I - 7) + (1 . 5 5)、(I - 7) + (1 . 5 6)、(I - 7) + (1 . 5 7)、(I - 7) + (1 . 5 8)、(I - 7) + (1 . 5 9)、(I - 7) + (1 . 6 0)、(I - 7) + (1 . 6 1)、(I - 7) + (1 . 6 2)、(I - 7) + (1 . 6 3)、(I - 7) + (1 . 6 4)、(I - 7) + (2 . 1)、(I - 7) + (2 . 2)、(I - 7) + (2 . 3)、(I - 7) + (2 . 4)、(I - 7) + (2 . 5)、(I - 7) + (2 . 6)、(I - 7) + (2 . 7)、(I - 7) + (2 . 8)、(I - 7) + (2 . 9)、(I - 7) + (2 . 1 0)、(I - 7) + (2 . 1 1)、(I - 7) + (2 . 1 2)、(I - 7) + (2 . 1 3)、(I - 7) + (2 . 1 4)、(I - 7) + (2 . 1 5)、(I - 7) + (2 . 1 6)、(I - 7) + (2 . 1 7)、(I - 7) + (2 . 1 8)、(I - 7) + (2 . 1 9)、(I - 7) + (2 . 2 0)、(I - 7) + (2 . 2 1)、(I - 7) + (2 . 2 2)、(I - 7) + (2 . 2 3)、(I - 7) + (2 . 2 4)、(I - 7) + (2 . 2 5)、(I - 7) + (2 . 2 6)、(I - 7) + (2 . 2 7)、(I - 7) + (2 . 2 8)、(I - 7) + (2 . 2 9)、(I - 7) + (3 . 1)、(I - 7) + (3 . 2)、(I - 7) + (3 . 3)、(I - 7) + (3 . 4)、(I - 7) + (3 . 5)、(I - 7) 10
 20
 30
 40
 50

$I - 7$) + (1 5 . 1 0)、($I - 7$) + (1 5 . 1 1)、($I - 7$) + (1 5 . 1 2)
 、($I - 7$) + (1 5 . 1 3)、($I - 7$) + (1 5 . 1 4)、($I - 7$) + (1 5 . 1
 5)、($I - 7$) + (1 5 . 1 6)、($I - 7$) + (1 5 . 1 7)、($I - 7$) + (1 5
 . 1 8)、($I - 7$) + (1 5 . 1 9)、($I - 7$) + (1 5 . 2 0)、($I - 7$) + (1
 5 . 2 1)、($I - 7$) + (1 5 . 2 2)、($I - 7$) + (1 5 . 2 3)、($I - 7$)
 + (1 5 . 2 4)、($I - 7$) + (1 5 . 2 5)、($I - 7$) + (1 5 . 2 6)、($I -$
 7) + (1 5 . 2 7)、($I - 7$) + (1 5 . 2 8)、($I - 7$) + (1 5 . 2 9)、($I -$
 7) + (1 5 . 3 0)、($I - 7$) + (1 5 . 3 1)、($I - 7$) + (1 5 . 3 2)
 、($I - 7$) + (1 5 . 3 3)、($I - 7$) + (1 5 . 3 4)、($I - 7$) + (1 5 . 3
 5)、($I - 7$) + (1 5 . 3 6)、($I - 7$) + (1 5 . 3 7)、($I - 7$) + (1 5
 . 3 8)、($I - 7$) + (1 5 . 3 9)、($I - 7$) + (1 5 . 4 1)、($I - 7$) + (1
 5 . 4 2)、($I - 7$) + (1 5 . 4 3)、($I - 7$) + (1 5 . 4 4)、($I - 7$)
 + (1 5 . 4 5)、($I - 7$) + (1 5 . 4 6)、($I - 7$) + (1 5 . 4 7)、($I -$
 7) + (1 5 . 4 8)、($I - 7$) + (1 5 . 4 9)、($I - 7$) + (1 5 . 5 0)、($I -$
 7) + (1 5 . 5 1)、($I - 7$) + (1 5 . 5 2)、($I - 7$) + (1 5 . 5 3)
 、($I - 7$) + (1 5 . 5 4)、($I - 7$) + (1 5 . 5 5)、($I - 7$) + (1 5 . 5
 6)、($I - 7$) + (1 5 . 5 7)、($I - 7$) + (1 5 . 5 8)、($I - 7$) + (1 5
 . 5 9)、($I - 7$) + (1 5 . 6 0)、($I - 7$) + (1 5 . 6 1)、($I - 7$) + (1
 5 . 6 2)、($I - 7$) + (1 5 . 6 3)、($I - 7$) + (1 5 . 6 4)、($I - 7$)
 + (1 5 . 6 5)、($I - 7$) + (1 5 . 6 6)、($I - 7$) + (1 5 . 6 7)、($I -$
 7) + (1 5 . 6 8)、($I - 7$) + (1 5 . 6 9)、($I - 7$) + (1 5 . 7 0)、($I -$
 7) + (1 5 . 7 1)、($I - 7$) + (1 5 . 7 2)、($I - 7$) + (1 5 . 7 3)
 、($I - 7$) + (1 5 . 7 4)、($I - 7$) + (1 5 . 7 5)、($I - 7$) + (1 5 . 7
 6)、($I - 7$) + (1 5 . 7 7)、($I - 7$) + (1 5 . 7 8)、($I - 7$) + (1 5
 . 7 9)、($I - 7$) + (1 5 . 8 0)、($I - 7$) + (1 5 . 8 1)、($I - 7$) + (1
 5 . 8 2)、($I - 7$) + (1 5 . 8 3)、($I - 7$) + (1 5 . 8 4)、($I - 7$)
 + (1 5 . 8 5)、($I - 7$) + (1 5 . 8 6)、($I - 7$) + (1 5 . 8 7)、($I -$
 7) + (1 5 . 8 8)、($I - 7$) + (1 5 . 8 9)、($I - 7$) + (1 5 . 9 0)、($I -$
 7) + (1 5 . 9 1)、($I - 7$) + (1 5 . 9 2)、($I - 7$) + (1 5 . 9 3)
 、($I - 7$) + (1 5 . 9 4)に関するものである。 30

【0048】

別の特に好ましい実施形態において本発明は、式(I)の化合物としての化合物($I -$
 7)および一つの成分(B)を含む混合物、特には混合物($I - 7$) + (2 . 1)、($I -$
 7) + (2 . 2)、($I - 7$) + (2 . 6)、($I - 7$) + (2 . 8)、($I - 7$) +
 (2 . 1 1)、($I - 7$) + (2 . 1 2)、($I - 7$) + (2 . 1 3)、($I - 7$) + (2
 . 1 4)、($I - 7$) + (2 . 1 5)、($I - 7$) + (2 . 1 6)、($I - 7$) + (2
 . 1 7)、($I - 7$) + (2 . 2 9)、($I - 7$) + (3 . 1)、($I - 7$) + (3 . 2)
 、($I - 7$) + (3 . 3)、($I - 7$) + (3 . 4)、($I - 7$) + (3 . 9)、($I -$
 7) + (3 . 1 0)、($I - 7$) + (3 . 1 2)、($I - 7$) + (3 . 1 6)、($I -$
 7) + (3 . 1 7)、($I - 7$) + (3 . 2 2)、($I - 7$) + (4 . 6)、($I - 7$)
 + (5 . 1)、($I - 7$) + (5 . 4)、($I - 7$) + (5 . 5)、($I - 7$) + (5
 . 7)、($I - 7$) + (5 . 8)、($I - 7$) + (5 . 9)、($I - 7$) + (5 . 1 6)、
 ($I - 7$) + (5 . 2 3)、($I - 7$) + (5 . 2 5)、($I - 7$) + (5 . 2 6)、($I -$
 7) + (5 . 2 9)、($I - 7$) + (5 . 3 0)、($I - 7$) + (7 . 7)、($I -$
 7) + (9 . 2)、($I - 7$) + (9 . 4)、($I - 7$) + (9 . 5)、($I - 7$) + (1
 0 . 9)、($I - 7$) + (1 0 . 1 0)、($I - 7$) + (1 2 . 9)、($I - 7$) + (1
 2 . 1 0)、($I - 7$) + (1 4 . 4)、($I - 7$) + (1 5 . 9)、($I - 7$) + (1
 5 . 2 4)、($I - 7$) + (1 5 . 2 5)、($I - 7$) + (1 5 . 2 6)、($I - 7$)
 + (1 5 . 4 1)、($I - 7$) + (1 5 . 4 2)、($I - 7$) + (1 5 . 5 4)、($I -$
 7) + (1 5 . 5 5)、($I - 7$) + (1 5 . 5 6)、($I - 7$) + (1 5 . 6 0)、(40

I - 7) + (1 5 . 9 0) に関するものである。

【 0 0 4 9 】

ある好ましい実施形態において本発明は、式 (I) の化合物としての化合物 (I - 8) および一つの成分 (B) を含む混合物、特には混合物 (I - 8) + (1 . 1)、(I - 8) + (1 . 2)、(I - 8) + (1 . 3)、(I - 8) + (1 . 4)、(I - 8) + (1 . 5)、(I - 8) + (1 . 6)、(I - 8) + (1 . 7)、(I - 8) + (1 . 8)、(I - 8) + (1 . 9)、(I - 8) + (1 . 1 0)、(I - 8) + (1 . 1 1)、(I - 8) + (1 . 1 2)、(I - 8) + (1 . 1 3)、(I - 8) + (1 . 1 4)、(I - 8) + (1 . 1 5)、(I - 8) + (1 . 1 6)、(I - 8) + (1 . 1 7)、(I - 8) + (1 . 1 8)、(I - 8) + (1 . 1 9)、(I - 8) + (1 . 2 0)、(I - 8) + (1 . 2 1)、(I - 8) + (1 . 2 2)、(I - 8) + (1 . 2 3)、(I - 8) + (1 . 2 4)、(I - 8) + (1 . 2 5)、(I - 8) + (1 . 2 6)、(I - 8) + (1 . 2 7)、(I - 8) + (1 . 2 8)、(I - 8) + (1 . 2 9)、(I - 8) + (1 . 3 0)、(I - 8) + (1 . 3 1)、(I - 8) + (1 . 3 2)、(I - 8) + (1 . 3 3)、(I - 8) + (1 . 3 4)、(I - 8) + (1 . 3 5)、(I - 8) + (1 . 3 6)、(I - 8) + (1 . 3 7)、(I - 8) + (1 . 3 8)、(I - 8) + (1 . 3 9)、(I - 8) + (1 . 4 0)、(I - 8) + (1 . 4 1)、(I - 8) + (1 . 4 2)、(I - 8) + (1 . 4 3)、(I - 8) + (1 . 4 4)、(I - 8) + (1 . 4 5)、(I - 8) + (1 . 4 6)、(I - 8) + (1 . 4 7)、(I - 8) + (1 . 4 8)、(I - 8) + (1 . 4 9)、(I - 8) + (1 . 5 0)、(I - 8) + (1 . 5 1)、(I - 8) + (1 . 5 2)、(I - 8) + (1 . 5 3)、(I - 8) + (1 . 5 4)、(I - 8) + (1 . 5 5)、(I - 8) + (1 . 5 6)、(I - 8) + (1 . 5 7)、(I - 8) + (1 . 5 8)、(I - 8) + (1 . 5 9)、(I - 8) + (1 . 6 0)、(I - 8) + (1 . 6 1)、(I - 8) + (1 . 6 2)、(I - 8) + (1 . 6 3)、(I - 8) + (1 . 6 4)、(I - 8) + (2 . 1)、(I - 8) + (2 . 2)、(I - 8) + (2 . 3)、(I - 8) + (2 . 4)、(I - 8) + (2 . 5)、(I - 8) + (2 . 6)、(I - 8) + (2 . 7)、(I - 8) + (2 . 8)、(I - 8) + (2 . 9)、(I - 8) + (2 . 1 0)、(I - 8) + (2 . 1 1)、(I - 8) + (2 . 1 2)、(I - 8) + (2 . 1 3)、(I - 8) + (2 . 1 4)、(I - 8) + (2 . 1 5)、(I - 8) + (2 . 1 6)、(I - 8) + (2 . 1 7)、(I - 8) + (2 . 1 8)、(I - 8) + (2 . 1 9)、(I - 8) + (2 . 2 0)、(I - 8) + (2 . 2 1)、(I - 8) + (2 . 2 2)、(I - 8) + (2 . 2 3)、(I - 8) + (2 . 2 4)、(I - 8) + (2 . 2 5)、(I - 8) + (2 . 2 6)、(I - 8) + (2 . 2 7)、(I - 8) + (2 . 2 8)、(I - 8) + (2 . 2 9)、(I - 8) + (3 . 1)、(I - 8) + (3 . 2)、(I - 8) + (3 . 3)、(I - 8) + (3 . 4)、(I - 8) + (3 . 5)、(I - 8) + (3 . 6)、(I - 8) + (3 . 7)、(I - 8) + (3 . 8)、(I - 8) + (3 . 9)、(I - 8) + (3 . 1 0)、(I - 8) + (3 . 1 1)、(I - 8) + (3 . 1 2)、(I - 8) + (3 . 1 3)、(I - 8) + (3 . 1 4)、(I - 8) + (3 . 1 5)、(I - 8) + (3 . 1 6)、(I - 8) + (3 . 1 7)、(I - 8) + (3 . 1 8)、(I - 8) + (3 . 1 9)、(I - 8) + (3 . 2 0)、(I - 8) + (3 . 2 1)、(I - 8) + (3 . 2 2)、(I - 8) + (3 . 2 3)、(I - 8) + (3 . 2 4)、(I - 8) + (3 . 2 5)、(I - 8) + (3 . 2 6)、(I - 8) + (3 . 2 7)、(I - 8) + (3 . 2 8)、(I - 8) + (3 . 2 9)、(I - 8) + (3 . 3 0)、(I - 8) + (3 . 3 1)、(I - 8) + (3 . 3 2)、(I - 8) + (3 . 3 3)、(I - 8) + (4 . 1)、(I - 8) + (4 . 2)、(I - 8) + (4 . 3)、(I - 8) + (4 . 4)、(I - 8) + (4 . 5)、(I - 8) + (4 . 6)、(I - 8) + (4 . 7)、(I - 8) + (4 . 8)、(I - 8) + (4 . 9)、(I - 8) + (4 . 1 0)、(I - 8) + (4 . 1 1)、(I - 8) + (4 . 1 2)、(I - 8) + (4 . 1 3)、(I - 8) + (4 . 1 4)、(I - 8) + (5 . 1)、(I - 8) + (5 . 2)、(I - 8) + (5 . 3)、(I - 8) + (5 . 4)、(I - 8) + (5 . 5)、(I - 8) + (5 . 6)、 10 20 30 40 50

$(I - 8) + (5 . 7)$ 、 $(I - 8) + (5 . 8)$ 、 $(I - 8) + (5 . 9)$ 、 $(I - 8)$
 $+ (5 . 10)$ 、 $(I - 8) + (5 . 11)$ 、 $(I - 8) + (5 . 12)$ 、 $(I - 8)$
 $+ (5 . 13)$ 、 $(I - 8) + (5 . 14)$ 、 $(I - 8) + (5 . 15)$ 、 $(I - 8) +$
 $(5 . 16)$ 、 $(I - 8) + (5 . 17)$ 、 $(I - 8) + (5 . 18)$ 、 $(I - 8) +$
 $(5 . 19)$ 、 $(I - 8) + (5 . 20)$ 、 $(I - 8) + (5 . 21)$ 、 $(I - 8) + (5$
 $. 22)$ 、 $(I - 8) + (5 . 23)$ 、 $(I - 8) + (5 . 24)$ 、 $(I - 8) + (5 .$
 $25)$ 、 $(I - 8) + (5 . 26)$ 、 $(I - 8) + (5 . 27)$ 、 $(I - 8) + (5 . 2$
 $8)$ 、 $(I - 8) + (5 . 29)$ 、 $(I - 8) + (5 . 30)$ 、 $(I - 8) + (5 . 31$
 $)$ 、 $(I - 8) + (5 . 32)$ 、 $(I - 8) + (5 . 33)$ 、 $(I - 8) + (5 . 34$
 $)$ 、 $(I - 8) + (6 . 1)$ 、 $(I - 8) + (6 . 2)$ 、 $(I - 8) + (6 . 3)$ 、 $(I -$
 $8) + (6 . 4)$ 、 $(I - 8) + (7 . 1)$ 、 $(I - 8) + (7 . 2)$ 、 $(I - 8) +$
 $(7 . 3)$ 、 $(I - 8) + (7 . 4)$ 、 $(I - 8) + (7 . 5)$ 、 $(I - 8) + (7 . 6$
 $)$ 、 $(I - 8) + (7 . 7)$ 、 $(I - 8) + (7 . 8)$ 、 $(I - 8) + (8 . 1)$ 、 $(I -$
 $8) + (8 . 2)$ 、 $(I - 8) + (8 . 3)$ 、 $(I - 8) + (8 . 4)$ 、 $(I - 8) +$
 $(9 . 1)$ 、 $(I - 8) + (9 . 2)$ 、 $(I - 8) + (9 . 3)$ 、 $(I - 8) + (9 . 4$
 $)$ 、 $(I - 8) + (9 . 5)$ 、 $(I - 8) + (9 . 6)$ 、 $(I - 8) + (9 . 7)$ 、 $(I -$
 $8) + (9 . 8)$ 、 $(I - 8) + (9 . 9)$ 、 $(I - 8) + (10 . 1)$ 、 $(I - 8) +$
 $(10 . 2)$ 、 $(I - 8) + (10 . 3)$ 、 $(I - 8) + (10 . 4)$ 、 $(I - 8) +$
 $(10 . 5)$ 、 $(I - 8) + (10 . 6)$ 、 $(I - 8) + (10 . 7)$ 、 $(I - 8) + (1$
 $0 . 8)$ 、 $(I - 8) + (10 . 9)$ 、 $(I - 8) + (10 . 10)$ 、 $(I - 8) + (1$
 $0 . 11)$ 、 $(I - 8) + (10 . 12)$ 、 $(I - 8) + (10 . 13)$ 、 $(I - 8) +$
 $(10 . 14)$ 、 $(I - 8) + (10 . 15)$ 、 $(I - 8) + (11 . 1)$ 、 $(I - 8) +$
 $(11 . 2)$ 、 $(I - 8) + (11 . 3)$ 、 $(I - 8) + (11 . 4)$ 、 $(I - 8) +$
 $(11 . 5)$ 、 $(I - 8) + (11 . 6)$ 、 $(I - 8) + (11 . 7)$ 、 $(I - 8) +$
 $(12 . 1)$ 、 $(I - 8) + (12 . 2)$ 、 $(I - 8) + (12 . 3)$ 、 $(I - 8) + (1$
 $2 . 4)$ 、 $(I - 8) + (12 . 5)$ 、 $(I - 8) + (12 . 6)$ 、 $(I - 8) + (12$
 $. 7)$ 、 $(I - 8) + (12 . 8)$ 、 $(I - 8) + (12 . 9)$ 、 $(I - 8) + (12$
 $. 10)$ 、 $(I - 8) + (12 . 11)$ 、 $(I - 8) + (12 . 12)$ 、 $(I - 8) + (1$
 $2 . 13)$ 、 $(I - 8) + (13 . 1)$ 、 $(I - 8) + (13 . 2)$ 、 $(I - 8) + (1$
 $3 . 3)$ 、 $(I - 8) + (13 . 4)$ 、 $(I - 8) + (13 . 5)$ 、 $(I - 8) + (13$
 $. 6)$ 、 $(I - 8) + (13 . 7)$ 、 $(I - 8) + (14 . 1)$ 、 $(I - 8) + (14$
 $. 2)$ 、 $(I - 8) + (14 . 3)$ 、 $(I - 8) + (14 . 4)$ 、 $(I - 8) + (14 . 5$
 $)$ 、 $(I - 8) + (15 . 1)$ 、 $(I - 8) + (15 . 2)$ 、 $(I - 8) + (15 . 3)$
 $、(I - 8) + (15 . 4)$ 、 $(I - 8) + (15 . 5)$ 、 $(I - 8) + (15 . 6)$ 、
 $(I - 8) + (15 . 7)$ 、 $(I - 8) + (15 . 8)$ 、 $(I - 8) + (15 . 9)$ 、 $(I -$
 $8) + (15 . 10)$ 、 $(I - 8) + (15 . 11)$ 、 $(I - 8) + (15 . 12)$ 、 $(I -$
 $8) + (15 . 13)$ 、 $(I - 8) + (15 . 14)$ 、 $(I - 8) + (15 . 15$
 $)$ 、 $(I - 8) + (15 . 16)$ 、 $(I - 8) + (15 . 17)$ 、 $(I - 8) + (15$
 $. 18)$ 、 $(I - 8) + (15 . 19)$ 、 $(I - 8) + (15 . 20)$ 、 $(I - 8) + (1$
 $5 . 21)$ 、 $(I - 8) + (15 . 22)$ 、 $(I - 8) + (15 . 23)$ 、 $(I - 8) +$
 $(15 . 24)$ 、 $(I - 8) + (15 . 25)$ 、 $(I - 8) + (15 . 26)$ 、 $(I -$
 $8) + (15 . 27)$ 、 $(I - 8) + (15 . 28)$ 、 $(I - 8) + (15 . 29)$ 、 $(I -$
 $8) + (15 . 30)$ 、 $(I - 8) + (15 . 31)$ 、 $(I - 8) + (15 . 32)$
 $、(I - 8) + (15 . 33)$ 、 $(I - 8) + (15 . 34)$ 、 $(I - 8) + (15 . 3$
 $5)$ 、 $(I - 8) + (15 . 36)$ 、 $(I - 8) + (15 . 37)$ 、 $(I - 8) + (15$
 $. 38)$ 、 $(I - 8) + (15 . 39)$ 、 $(I - 8) + (15 . 41)$ 、 $(I - 8) +$
 $(15 . 42)$ 、 $(I - 8) + (15 . 43)$ 、 $(I - 8) + (15 . 44)$ 、 $(I - 8) +$
 $(15 . 45)$ 、 $(I - 8) + (15 . 46)$ 、 $(I - 8) + (15 . 47)$ 、 $(I -$
 $8) + (15 . 48)$ 、 $(I - 8) + (15 . 49)$ 、 $(I - 8) + (15 . 50)$ 、 $(I -$
 $8) + (15 . 51)$ 、 $(I - 8) + (15 . 52)$ 、 $(I - 8) + (15 . 53)$ 50

、(I-8)+(15.54)、(I-8)+(15.55)、(I-8)+(15.56)、(I-8)+(15.57)、(I-8)+(15.58)、(I-8)+(15.59)、(I-8)+(15.60)、(I-8)+(15.61)、(I-8)+(15.62)、(I-8)+(15.63)、(I-8)+(15.64)、(I-8)+(15.65)、(I-8)+(15.66)、(I-8)+(15.67)、(I-8)+(15.68)、(I-8)+(15.69)、(I-8)+(15.70)、(I-8)+(15.71)、(I-8)+(15.72)、(I-8)+(15.73)、(I-8)+(15.74)、(I-8)+(15.75)、(I-8)+(15.76)、(I-8)+(15.77)、(I-8)+(15.78)、(I-8)+(15.79)、(I-8)+(15.80)、(I-8)+(15.81)、(I-8)+(15.82)、(I-8)+(15.83)、(I-8)+(15.84)、(I-8)+(15.85)、(I-8)+(15.86)、(I-8)+(15.87)、(I-8)+(15.88)、(I-8)+(15.89)、(I-8)+(15.90)、(I-8)+(15.91)、(I-8)+(15.92)、(I-8)+(15.93)、(I-8)+(15.94)に関するものである。
 10

【0050】

別の特に好ましい実施形態において本発明は、式(I)の化合物としての化合物(I-8)および一つの成分(B)を含む混合物、特には混合物(I-8)+(2.1)、(I-8)+(2.2)、(I-8)+(2.6)、(I-8)+(2.8)、(I-8)+(2.11)、(I-8)+(2.12)、(I-8)+(2.13)、(I-8)+(2.14)、(I-8)+(2.15)、(I-8)+(2.16)、(I-8)+(2.17)、(I-8)+(2.29)、(I-8)+(3.1)、(I-8)+(3.2)、(I-8)+(3.3)、(I-8)+(3.4)、(I-8)+(3.9)、(I-8)+(3.10)、(I-8)+(3.12)、(I-8)+(3.16)、(I-8)+(3.17)、(I-8)+(3.22)、(I-8)+(4.6)、(I-8)+(5.1)、(I-8)+(5.4)、(I-8)+(5.5)、(I-8)+(5.7)、(I-8)+(5.8)、(I-8)+(5.9)、(I-8)+(5.16)、(I-8)+(5.23)、(I-8)+(5.25)、(I-8)+(5.26)、(I-8)+(5.29)、(I-8)+(5.30)、(I-8)+(7.7)、(I-8)+(9.2)、(I-8)+(9.4)、(I-8)+(9.5)、(I-8)+(10.9)、(I-8)+(10.10)、(I-8)+(12.9)、(I-8)+(12.10)、(I-8)+(14.4)、(I-8)+(15.9)、(I-8)+(15.24)、(I-8)+(15.25)、(I-8)+(15.26)、(I-8)+(15.41)、(I-8)+(15.42)、(I-8)+(15.54)、(I-8)+(15.55)、(I-8)+(15.56)、(I-8)+(15.60)、(I-8)+(15.90)に関するものである。
 20
 30

【0051】

ある好ましい実施形態において本発明は、式(I)の化合物としての化合物(I-9)および一つの成分(B)を含む混合物、特には混合物(I-9)+(1.1)、(I-9)+(1.2)、(I-9)+(1.3)、(I-9)+(1.4)、(I-9)+(1.5)、(I-9)+(1.6)、(I-9)+(1.7)、(I-9)+(1.8)、(I-9)+(1.9)、(I-9)+(1.10)、(I-9)+(1.11)、(I-9)+(1.12)、(I-9)+(1.13)、(I-9)+(1.14)、(I-9)+(1.15)、(I-9)+(1.16)、(I-9)+(1.17)、(I-9)+(1.18)、(I-9)+(1.19)、(I-9)+(1.20)、(I-9)+(1.21)、(I-9)+(1.22)、(I-9)+(1.23)、(I-9)+(1.24)、(I-9)+(1.25)、(I-9)+(1.26)、(I-9)+(1.27)、(I-9)+(1.28)、(I-9)+(1.29)、(I-9)+(1.30)、(I-9)+(1.31)、(I-9)+(1.32)、(I-9)+(1.33)、(I-9)+(1.34)、(I-9)+(1.35)、(I-9)+(1.3) 50

$(6) + (I - 9) + (1.37) + (I - 9) + (1.38) + (I - 9) + (1.39)$
 $(I - 9) + (1.40) + (I - 9) + (1.41) + (I - 9) + (1.42)$
 $(I - 9) + (1.43) + (I - 9) + (1.44) + (I - 9) + (1.45)$
 $(I - 9) + (1.46) + (I - 9) + (1.47) + (I - 9) + (1.48)$
 $(I - 9) + (1.49) + (I - 9) + (1.50) + (I - 9) + (1.51)$
 $(I - 9) + (1.52) + (I - 9) + (1.53) + (I - 9) + (1.54)$
 $(I - 9) + (1.55) + (I - 9) + (1.56) + (I - 9) + (1.57)$
 $(I - 9) + (1.58) + (I - 9) + (1.59) + (I - 9) + (1.60)$
 $(I - 9) + (1.61) + (I - 9) + (1.62) + (I - 9) + (1.63)$
 $(I - 9) + (1.64) + (I - 9) + (2.1) + (I - 9) + (2.2)$
 $(I - 9) + (2.3) + (I - 9) + (2.4) + (I - 9) + (2.5)$
 $(I - 9) + (2.6) + (I - 9) + (2.7) + (I - 9) + (2.8)$
 $(I - 9) + (2.9) + (I - 9) + (2.10) + (I - 9) + (2.11)$
 $(I - 9) + (2.12) + (I - 9) + (2.13) + (I - 9) + (2.14)$
 $(I - 9) + (2.15) + (I - 9) + (2.16) + (I - 9) + (2.17)$
 $(I - 9) + (2.18) + (I - 9) + (2.19) + (I - 9) + (2.20)$
 $(I - 9) + (2.21) + (I - 9) + (2.22) + (I - 9) + (2.23)$
 $(I - 9) + (2.24) + (I - 9) + (2.25) + (I - 9) + (2.26)$
 $(I - 9) + (2.27) + (I - 9) + (2.28) + (I - 9) + (2.29)$
 $(I - 9) + (3.1) + (I - 9) + (3.2) + (I - 9) + (3.3)$
 $(I - 9) + (3.4) + (I - 9) + (3.5) + (I - 9) + (3.6)$
 $(I - 9) + (3.7) + (I - 9) + (3.8) + (I - 9) + (3.9)$
 $(I - 9) + (3.10) + (I - 9) + (3.11) + (I - 9) + (3.12)$
 $(I - 9) + (3.13) + (I - 9) + (3.14) + (I - 9) + (3.15)$
 $(I - 9) + (3.16) + (I - 9) + (3.17) + (I - 9) + (3.18)$
 $(I - 9) + (3.19) + (I - 9) + (3.20) + (I - 9) + (3.21)$
 $(I - 9) + (3.22) + (I - 9) + (3.23) + (I - 9) + (3.24)$
 $(I - 9) + (3.25) + (I - 9) + (3.26) + (I - 9) + (3.27)$
 $(I - 9) + (3.28) + (I - 9) + (3.29) + (I - 9) + (3.30)$
 $(I - 9) + (3.31) + (I - 9) + (3.32) + (I - 9) + (3.33)$
 $(I - 9) + (4.1) + (I - 9) + (4.2) + (I - 9) + (4.3)$
 $(I - 9) + (4.4) + (I - 9) + (4.5) + (I - 9) + (4.6)$
 $(I - 9) + (4.7) + (I - 9) + (4.8) + (I - 9) + (4.9)$
 $(I - 9) + (4.10) + (I - 9) + (4.11) + (I - 9) + (4.12)$
 $(I - 9) + (4.13) + (I - 9) + (4.14) + (I - 9) + (5.1)$
 $(I - 9) + (5.2) + (I - 9) + (5.3) + (I - 9) + (5.4)$
 $(I - 9) + (5.5) + (I - 9) + (5.6) + (I - 9) + (5.7)$
 $(I - 9) + (5.8) + (I - 9) + (5.9) + (I - 9) + (5.10)$
 $(I - 9) + (5.11) + (I - 9) + (5.12) + (I - 9) + (5.13)$
 $(I - 9) + (5.14) + (I - 9) + (5.15) + (I - 9) + (5.16)$
 $(I - 9) + (5.17) + (I - 9) + (5.18) + (I - 9) + (5.19)$
 $(I - 9) + (5.20) + (I - 9) + (5.21) + (I - 9) + (5.22)$
 $(I - 9) + (5.23) + (I - 9) + (5.24) + (I - 9) + (5.25)$
 $(I - 9) + (5.26) + (I - 9) + (5.27) + (I - 9) + (5.28)$
 $(I - 9) + (5.29) + (I - 9) + (5.30) + (I - 9) + (5.31)$
 $(I - 9) + (5.32) + (I - 9) + (5.33) + (I - 9) + (5.34)$
 $(I - 9) + (6.1) + (I - 9) + (6.2) + (I - 9) + (6.3)$
 $(I - 9) + (6.4) + (I - 9) + (7.1) + (I - 9) + (7.2)$
 $(I - 9) + (7.3) + (I - 9) + (7.4) + (I - 9) + (7.5)$
 $(I - 9) + (7.6) + (I - 9) + (7.7) + (I - 9) + (7.8)$
 $(I - 9) + (8.1) + (I - 9) + (8.2) + (I - 9) + (8.3)$
 $(I - 9) + (8.4) + (I - 9) + (9.1) + (I - 9) + (9.2)$
 $(I - 9) + (9.3) + (I - 9) + (9.4)$

、(I-9)+(9.5)、(I-9)+(9.6)、(I-9)+(9.7)、(I-9)+(9.8)、(I-9)+(9.9)、(I-9)+(10.1)、(I-9)+(10.2)、(I-9)+(10.3)、(I-9)+(10.4)、(I-9)+(10.5)、(I-9)+(10.6)、(I-9)+(10.7)、(I-9)+(10.8)、(I-9)+(10.9)、(I-9)+(10.10)、(I-9)+(10.11)、(I-9)+(10.12)、(I-9)+(10.13)、(I-9)+(10.14)、(I-9)+(10.15)、(I-9)+(11.1)、(I-9)+(11.2)、(I-9)+(11.3)、(I-9)+(11.4)、(I-9)+(11.5)、(I-9)+(11.6)、(I-9)+(11.7)、(I-9)+(12.1)、(I-9)+(12.2)、(I-9)+(12.3)、(I-9)+(12.4)、(I-9)+(12.5)、(I-9)+(12.6)、(I-9)+(12.7)、(I-9)+(12.8)、(I-9)+(12.9)、(I-9)+(12.10)、(I-9)+(12.11)、(I-9)+(12.12)、(I-9)+(12.13)、(I-9)+(13.1)、(I-9)+(13.2)、(I-9)+(13.3)、(I-9)+(13.4)、(I-9)+(13.5)、(I-9)+(13.6)、(I-9)+(13.7)、(I-9)+(14.1)、(I-9)+(14.2)、(I-9)+(14.3)、(I-9)+(14.4)、(I-9)+(14.5)、(I-9)+(15.1)、(I-9)+(15.2)、(I-9)+(15.3)、(I-9)+(15.4)、(I-9)+(15.5)、(I-9)+(15.6)、(I-9)+(15.7)、(I-9)+(15.8)、(I-9)+(15.9)、(I-9)+(15.10)、(I-9)+(15.11)、(I-9)+(15.12)、(I-9)+(15.13)、(I-9)+(15.14)、(I-9)+(15.15)、(I-9)+(15.16)、(I-9)+(15.17)、(I-9)+(15.18)、(I-9)+(15.19)、(I-9)+(15.20)、(I-9)+(15.21)、(I-9)+(15.22)、(I-9)+(15.23)、(I-9)+(15.24)、(I-9)+(15.25)、(I-9)+(15.26)、(I-9)+(15.27)、(I-9)+(15.28)、(I-9)+(15.29)、(I-9)+(15.30)、(I-9)+(15.31)、(I-9)+(15.32)、(I-9)+(15.33)、(I-9)+(15.34)、(I-9)+(15.35)、(I-9)+(15.36)、(I-9)+(15.37)、(I-9)+(15.38)、(I-9)+(15.39)、(I-9)+(15.41)、(I-9)+(15.42)、(I-9)+(15.43)、(I-9)+(15.44)、(I-9)+(15.45)、(I-9)+(15.46)、(I-9)+(15.47)、(I-9)+(15.48)、(I-9)+(15.49)、(I-9)+(15.50)、(I-9)+(15.51)、(I-9)+(15.52)、(I-9)+(15.53)、(I-9)+(15.54)、(I-9)+(15.55)、(I-9)+(15.56)、(I-9)+(15.57)、(I-9)+(15.58)、(I-9)+(15.59)、(I-9)+(15.60)、(I-9)+(15.61)、(I-9)+(15.62)、(I-9)+(15.63)、(I-9)+(15.64)、(I-9)+(15.65)、(I-9)+(15.66)、(I-9)+(15.67)、(I-9)+(15.68)、(I-9)+(15.69)、(I-9)+(15.70)、(I-9)+(15.71)、(I-9)+(15.72)、(I-9)+(15.73)、(I-9)+(15.74)、(I-9)+(15.75)、(I-9)+(15.76)、(I-9)+(15.77)、(I-9)+(15.78)、(I-9)+(15.79)、(I-9)+(15.80)、(I-9)+(15.81)、(I-9)+(15.82)、(I-9)+(15.83)、(I-9)+(15.84)、(I-9)+(15.85)、(I-9)+(15.86)、(I-9)+(15.87)、(I-9)+(15.88)、(I-9)+(15.89)、(I-9)+(15.90)、(I-9)+(15.91)、(I-9)+(15.92)、(I-9)+(15.93)、(I-9)+(15.94)に関するものである。

〔 0 0 5 2 〕

別の特に好ましい実施形態において本発明は、式(I)の化合物としての化合物(I-9)および一つの成分(B)を含む混合物、特には混合物(I-9)+(2.1)、(I-9)+(2.2)、(I-9)+(2.6)、(I-9)+(2.8)、(I-9)+(2.11)、(I-9)+(2.12)、(I-9)+(2.13)、(I-9)+(2.14)、(I-9)+(2.15)、(I-9)+(2.16)、(I-9)+(2.17)、(I-9)+(2.29)、(I-9)+(3.1)、(I-9)+(3.2)、(I-9)+(3.3)、(I-9)+(3.4)、(I-9)+(3.9)、(I-9)+(3.10)、(I-9)+(3.12)、(I-9)+(3.16)、(I-9)+(3.17)、(I-9)+(3.22)、(I-9)+(4.6)、(I-9)+(5.1)、(I-9)+(5.4)、(I-9)+(5.5)、(I-9)+(5.7)、(I-9)+(5.8)、(I-9)+(5.9)、(I-9)+(5.16)、(I-9)+(5.23)、(I-9)+(5.25)、(I-9)+(5.26)、(I-9)+(5.29)、(I-9)+(5.30)、(I-9)+(7.7)、(I-9)+(9.2)、(I-9)+(9.4)、(I-9)+(9.5)、(I-9)+(10.9)、(I-9)+(10.10)、(I-9)+(12.9)、(I-9)+(12.10)、(I-9)+(14.4)、(I-9)+(15.9)、(I-9)+(15.24)、(I-9)+(15.25)、(I-9)+(15.26)、(I-9)+(15.41)、(I-9)+(15.42)、(I-9)+(15.54)、(I-9)+(15.55)、(I-9)+(15.56)、(I-9)+(15.60)、(I-9)+(15.90)に関するものである。
10
20

【 0 0 5 3 】

$(1.3) + (I-1.0) + (2.1.4) + (I-1.0) + (2.1.5) + (I-1.0) +$
 $(2.1.6) + (I-1.0) + (2.1.7) + (I-1.0) + (2.1.8) + (I-1.0) +$
 $(2.1.9) + (I-1.0) + (2.2.0) + (I-1.0) + (2.2.1) + (I-1.0) +$
 $(2.2.2) + (I-1.0) + (2.2.3) + (I-1.0) + (2.2.4) + (I-1.0) +$
 $(2.2.5) + (I-1.0) + (2.2.6) + (I-1.0) + (2.2.7) + (I-1.0) +$
 $(2.2.8) + (I-1.0) + (2.2.9) + (I-1.0) + (3.1) + (I-1.0) +$
 $(3.2) + (I-1.0) + (3.3) + (I-1.0) + (3.4) + (I-1.0) + (3.5) +$
 $(I-1.0) + (3.6) + (I-1.0) + (3.7) + (I-1.0) + (3.8) + (I-1.0) +$
 $(3.9) + (I-1.0) + (3.10) + (I-1.0) + (3.11) + (I-1.0) + (3.12) +$
 $(I-1.0) + (3.13) + (I-1.0) + (3.14) + (I-1.0) + (3.15) + (I-1.0) +$
 $(3.16) + (I-1.0) + (3.17) + (I-1.0) + (3.18) + (I-1.0) + (3.19) +$
 $(I-1.0) + (3.20) + (I-1.0) + (3.21) + (I-1.0) + (3.22) + (I-1.0) +$
 $(3.23) + (I-1.0) + (3.24) + (I-1.0) + (3.25) + (I-1.0) + (3.26) +$
 $(I-1.0) + (3.27) + (I-1.0) + (3.28) + (I-1.0) + (3.29) + (I-1.0) +$
 $(3.30) + (I-1.0) + (3.31) + (I-1.0) + (3.32) + (I-1.0) + (3.33) +$
 $(I-1.0) + (4.1) + (I-1.0) + (4.2) + (I-1.0) + (4.3) + (I-1.0) +$
 $(4.4) + (I-1.0) + (4.5) + (I-1.0) + (4.6) + (I-1.0) + (4.7) + (I-1.0) +$
 $(4.8) + (I-1.0) + (4.9) + (I-1.0) + (4.10) + (I-1.0) + (4.11) +$
 $(I-1.0) + (4.12) + (I-1.0) + (4.13) + (I-1.0) + (4.14) + (I-1.0) +$
 $(5.1) + (I-1.0) + (5.2) + (I-1.0) + (5.3) + (I-1.0) + (5.4) + (I-1.0) +$
 $(5.5) + (I-1.0) + (5.6) + (I-1.0) + (5.7) + (I-1.0) + (5.8) + (I-1.0) +$
 $(5.9) + (I-1.0) + (5.10) + (I-1.0) + (5.11) + (I-1.0) + (5.12) +$
 $(I-1.0) + (5.13) + (I-1.0) + (5.14) + (I-1.0) + (5.15) + (I-1.0) +$
 $(5.16) + (I-1.0) + (5.17) + (I-1.0) + (5.18) + (I-1.0) + (5.19) +$
 $(I-1.0) + (5.20) + (I-1.0) + (5.21) + (I-1.0) + (5.22) + (I-1.0) +$
 $(5.23) + (I-1.0) + (5.24) + (I-1.0) + (5.25) + (I-1.0) + (5.26) +$
 $(I-1.0) + (5.27) + (I-1.0) + (5.28) + (I-1.0) + (5.29) + (I-1.0) +$
 $(5.30) + (I-1.0) + (5.31) + (I-1.0) + (5.32) + (I-1.0) + (5.33) +$
 $(I-1.0) + (5.34) + (I-1.0) + (6.1) + (I-1.0) + (6.2) + (I-1.0) +$
 $(6.3) + (I-1.0) + (6.4) + (I-1.0) + (7.1) + (I-1.0) + (7.2) + (I-1.0) +$
 $(7.3) + (I-1.0) + (7.4) + (I-1.0) + (7.5) + (I-1.0) + (7.6) + (I-1.0) +$
 $(7.7) + (I-1.0) + (7.8) + (I-1.0) + (8.1) + (I-1.0) + (8.2) + (I-1.0) +$
 $(8.3) + (I-1.0) + (8.4) + (I-1.0) + (9.1) + (I-1.0) + (9.2) + (I-1.0) +$
 $(9.3) + (I-1.0) + (9.4) + (I-1.0) + (9.5) + (I-1.0) + (9.6) + (I-1.0) +$
 $(9.7) + (I-1.0) + (9.8) + (I-1.0) + (9.9) + (I-1.0) + (10.1) + (I-1.0) +$
 $(10.2) + (I-1.0) + (10.3) + (I-1.0) + (10.4) + (I-1.0) + (10.5) + (I-1.0) +$
 $(10.6) + (I-1.0) + (10.7) + (I-1.0) + (10.8) + (I-1.0) + (10.9) + (I-1.0) +$
 $(10.10) + (I-1.0) + (10.11) + (I-1.0) + (10.12) + (I-1.0) + (10.13) +$
 $(I-1.0) + (10.14) + (I-1.0) + (10.15) + (I-1.0) + (11.1) + (I-1.0) +$
 $(11.2) + (I-1.0) + (11.3) + (I-1.0) + (11.4) + (I-1.0) + (11.5) + (I-1.0) +$
 $(11.6) + (I-1.0) + (11.7) + (I-1.0) + (12.1) + (I-1.0) + (12.2)$

2) 、 (I - 1 0) + (1 2 . 3) 、 (I - 1 0) + (1 2 . 4) 、 (I - 1 0) + (1 2 . 5) 、 (I - 1 0) + (1 2 . 6) 、 (I - 1 0) + (1 2 . 7) 、 (I - 1 0) + (1 2 . 8) 、 (I - 1 0) + (1 2 . 9) 、 (I - 1 0) + (1 2 . 1 0) 、 (I - 1 0) + (1 2 . 1 1) 、 (I - 1 0) + (1 2 . 1 2) 、 (I - 1 0) + (1 2 . 1 3) 、 (I - 1 0) + (1 3 . 1) 、 (I - 1 0) + (1 3 . 2) 、 (I - 1 0) + (1 3 . 3) 、 (I - 1 0) + (1 3 . 4) 、 (I - 1 0) + (1 3 . 5) 、 (I - 1 0) + (1 3 . 6) 、 (I - 1 0) + (1 3 . 7) 、 (I - 1 0) + (1 4 . 1) 、 (I - 1 0) + (1 4 . 2) 、 (I - 1 0) + (1 4 . 3) 、 (I - 1 0) + (1 4 . 4) 、 (I - 1 0) + (1 4 . 5) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 1) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 2) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 3) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 4) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 5) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 6) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 7) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 8) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 9) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 1 0) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 1 1) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 1 2) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 1 3) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 1 4) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 1 5) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 1 6) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 1 7) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 1 8) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 1 9) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 2 0) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 2 1) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 2 2) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 2 3) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 2 4) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 2 5) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 2 6) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 2 7) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 2 8) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 2 9) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 3 0) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 3 1) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 3 2) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 3 3) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 3 4) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 3 5) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 3 6) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 3 7) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 3 8) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 3 9) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 4 1) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 4 2) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 4 3) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 4 4) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 4 5) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 4 6) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 4 7) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 4 8) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 4 9) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 5 0) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 5 1) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 5 2) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 5 3) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 5 4) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 5 5) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 5 6) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 5 7) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 5 8) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 5 9) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 6 0) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 6 1) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 6 2) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 6 3) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 6 4) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 6 5) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 6 6) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 6 7) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 6 8) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 6 9) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 7 0) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 7 1) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 7 2) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 7 3) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 7 4) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 7 5) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 7 6) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 7 7) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 7 8) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 7 9) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 8 0) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 8 1) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 8 2) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 8 3) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 8 4) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 8 5) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 8 6) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 8 7) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 8 8) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 8 9) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 9 0) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 9 1) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 9 2) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 9 3) 、 (I - 1 0) + (1 5 . 9 4) にに関するものである。

【 0 0 5 4 】

別の特に好ましい実施形態において本発明は、式 (I) の化合物としての化合物 (I - 1 0) および一つの成分 (B) を含む混合物、特には混合物 (I - 1 0) + (2 . 1) 、 (I - 1 0) + (2 . 2) 、 (I - 1 0) + (2 . 6) 、 (I - 1 0) + (2 . 8) 、 (I - 1 0) + (2 . 1 1) 、 (I - 1 0) + (2 . 1 2) 、 (I - 1 0) + (2 . 1 3) 、 (I - 1 0) + (2 . 1 4) 、 (I - 1 0) + (2 . 1 5) 、 (I - 1 0) + (2 . 1

10

20

30

40

50

6)、(I - 1 0) + (2 . 1 7)、(I - 1 0) + (2 . 2 9)、(I - 1 0) + (3 . 1)、(I - 1 0) + (3 . 2)、(I - 1 0) + (3 . 3)、(I - 1 0) + (3 . 4)、(I - 1 0) + (3 . 9)、(I - 1 0) + (3 . 1 0)、(I - 1 0) + (3 . 1 2)、(I - 1 0) + (3 . 1 6)、(I - 1 0) + (3 . 1 7)、(I - 1 0) + (3 . 2 2)、(I - 1 0) + (4 . 6)、(I - 1 0) + (5 . 1)、(I - 1 0) + (5 . 4)、(I - 1 0) + (5 . 5)、(I - 1 0) + (5 . 7)、(I - 1 0) + (5 . 8)、(I - 1 0) + (5 . 9)、(I - 1 0) + (5 . 1 6)、(I - 1 0) + (5 . 2 3)、(I - 1 0) + (5 . 2 5)、(I - 1 0) + (5 . 2 6)、(I - 1 0) + (5 . 2 9)、(I - 1 0) + (5 . 3 0)、(I - 1 0) + (7 . 7)、(I - 1 0) + (9 . 2)、(I - 1 0) + (9 . 4)、(I - 1 0) + (9 . 5)、(I - 1 0) + (1 0 . 9)、(I - 1 0) + (1 0 . 1 0)、(I - 1 0) + (1 2 . 9)、(I - 1 0) + (1 2 . 1 0)、(I - 1 0) + (1 4 . 4)、(I - 1 0) + (1 5 . 9)、(I - 1 0) + (1 5 . 2 4)、(I - 1 0) + (1 5 . 2 5)、(I - 1 0) + (1 5 . 2 6)、(I - 1 0) + (1 5 . 4 1)、(I - 1 0) + (1 5 . 4 2)、(I - 1 0) + (1 5 . 5 4)、(I - 1 0) + (1 5 . 5 5)、(I - 1 0) + (1 5 . 5 6)、(I - 1 0) + (1 5 . 6 0)、(I - 1 0) + (1 5 . 9 0)に関するものである。
 10

【0055】

本発明による活性化合物組み合わせ中の活性化合物が一定の重量比で存在する場合、相乗効果が特に顕著となる。しかしながら、活性化合物組み合わせ中の活性化合物の重量比は、比較的広い範囲内で変動させることができる。
 20

【0056】

本発明による組み合わせにおいて、化合物(A)および(B)は、1000:1から1:1000の範囲のA:Bの相乗効果的重量比で、好ましくは100:1から1:100の重量比、最も好ましくは50:1から1:500の重量比で存在する。本発明に従つて使用可能なA:Bの別の比率は、好ましさが増す順で、750:1から1:750、500:1から1:500、300:1から1:300、250:1から1:250、220:1から1:220、200:1から1:200、170:1から1:170、140:1から1:140、120:1から1:120、100:1から1:100、95:1から1:95、90:1から1:90、85:1から1:85、80:1から1:80、75:1から1:75、70:1から1:70、65:1から1:65、60:1から1:60、55:1から1:55、45:1から1:45、40:1から1:40、35:1から1:35、30:1から1:30、25:1から1:25、15:1から1:15、10:1から1:10、5:1から1:5、4:1から1:4、3:1から1:3、2:1から1:2ならびに10:1から1:1000および1:1から1:1000である。
 30

【0057】

化合物(A)または化合物(B)は、各種の可能な異性体型の、特には例えばEとZ、トレオとエリトロなどの立体異性体、そしてさらには光学異性体、ならびに適切な場合は互変異体の混合物として存在し得る。特許請求されるものは、E異性体とZ異性体そしてトレオとエリトロの両方、さらには光学異性体(RおよびS)、これら異性体のいずれかの混合物、ならびに可能な互変異型である。
 40

【0058】

少なくとも一つの塩基性中心を有する化合物(A)または化合物(B)は例えば、例えば過塩素酸、硫酸、硝酸、亜硝酸、リン酸またはハロ水素酸などの鉱酸などの強無機酸と、置換されていない置換されている、例えばハロ置換されているC₁-C₄アルカンカルボン酸(例えば酢酸)、飽和もしくは不飽和のジカルボン酸(例えばシュウ酸、マロン酸、コハク酸、マレイン酸、フマル酸およびタル酸)、ヒドロキシカルボン酸(例えば、アスコルビン酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸およびクエン酸)または安息香酸などの強有機カルボン酸と、または置換されていないか置換されている、例えばハロ置換されているC₁-C₄アルカン-もしくはアリール-スルホン酸(例えば、メタン-またはp-トルエ
 50

ン - スルホン酸)などの有機スルホン酸と酸付加塩を形成することができる。少なくとも一つの酸基を有する化合物(A)または化合物(B)は、例えば塩基との塩、例えばアルカリ金属またはアルカリ土類金属塩(例えば、ナトリウム、カリウムまたはマグネシウム塩)などの金属塩、あるいはアンモニアまたはモルホリン、ピペリジン、ピロリジン、モノ-、ジ-もしくはトリ-低級アルキルアミン(例えば、エチル-、ジエチル-、トリエチル-もしくはジメチル-プロピル-アミン)またはモノ-、ジ-もしくはトリ-ヒドロキシ-低級アルキルアミン(例えば、モノ-、ジ-もしくはトリ-エタノールアミン)などの有機アミンとの塩を形成することができる。さらに、相当する内部塩が形成されても良い。本発明の文脈において、好ましいものは、農芸化学的に有利な塩である。遊離形態もしくはそれの塩の形態での化合物(A)と化合物(B)との間の関係の近さを考慮すると、上記および下記において、遊離化合物(A)もしくは遊離化合物(B)またはそれらの塩について言及することは、適切かつ好都合な場合に、相当する塩またはそれら遊離化合物(A)もしくは遊離化合物(B)も含むものと理解すべきである。化合物(A)もしくは化合物(B)の互変異体およびそれらの塩にも同じことが当てはまる。

10

20

30

40

【0059】

本発明によれば、「組み合わせ」という表現は、例えば単独の「調合済み」型、「タンクミックス」などの単独活性化合物の別個製剤から成る組み合わせ噴霧混合物、および連續式で、即ち数時間または数日などのかなり短い期間内で順次施用される場合の単独活性成分の併用において、化合物(A)および(B)の各種組み合わせを表す。好ましくは、化合物(A)および(B)の施用順序は本発明の実施においてあまり重要ではない。

【0060】

方法および中間体の説明

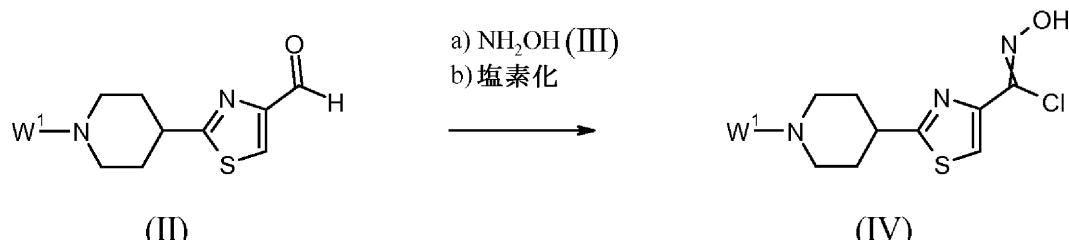
式(I)のビス(ジフルオロメチル)ピラゾール誘導体は、各種方法で製造することができる。第一に、可能な方法を以下において模式的に示す。別段の断りがない限り、記述される基はそれぞれ上記で定義の通りである。

【0061】

方法A図式1：方法A

【0062】

【化3】



W¹は、アセチル、C₁-C₄-アルコキシカルボニル、ベンジル、ベンジルオキシカルボニルまたは[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチルである。

【0063】

化合物(I)から中間体(IV)を製造する一つの手段を図式1(方法A)に示してある。

【0064】

一般式(IV)の化合物は、式(I)のアルデヒドのヒドロキシルアミン(III)との縮合およびその後の塩素化によって得られる(例えばWO05/0040159、WO08/013622およびSynthesis 1987, 11, 998-1001を参照)。

【0065】

方法Aでは、アルデヒド(I)およびヒドロキシルアミン(III)を最初に反応さ

50

せる(図式1、段階(a))。次に、相当するオキシムを、好適な塩素化剤の存在下に塩素化する。好ましい塩素化試薬は、N-クロロコハク酸イミド、HClOおよび塩素である。方法Aの段階(a)の後、反応混合物を一般的方法によって後処理するか、さらに段階(b)で直接変換することができる。

(0 0 6 6)

アルデヒド(II)は市販されているか(W¹ = t-ブトキシカルボニルの場合: Maybridge)、文献に記載の方法によって市販の前駆体から製造することができる。例えば、アルデヒド(II)は、0°Cでテトラヒドロフラン中の水素化リチウムアルミニウムによる還元と、次に生成したアルコールのジクロロメタン中室温でのデス・マーチンペルヨージナン試薬による酸化によって、相当するメチルまたはエチルエステルを原料として製造することができる(例えば水素化リチウムアルミニウムによる還元についてはWO 07/147336およびWO 07/039177を、デス・マーチンペルヨージナン試薬による酸化についてはJ. Am. Chem. Soc. 1978, 100, 300-301; 1979, 101, 5294-5299; 1991, 113, 7277-7287を参照する。)。

〔 0 0 6 7 〕

方法 A は好ましくは、1 以上の希釈剤を用いて行う。本発明による方法 A の段階 (a)において、好ましくは、溶媒として例えばエタノールなどのプロトン性溶媒を用いる。化合物 (I I) から相当するオキシムを形成した後、反応混合物を、段階 (b) において、例えばテトラヒドロフランなどの別の溶媒で希釈し、次に次亜塩素酸ナトリウムと混合する。その塩素化は、D M F 中 N - クロロコハク酸イミドを用いて同様に行うことが可能である。

[0 0 6 8]

方法 A を行う上で、反応温度は比較的広い範囲で変動し得る。通常、用いられる温度は、段階 (a) において -10 から +150 、好ましくは 0 から +100 の温度、最も好ましくは溶媒の還流温度、そして段階 (b) で 0 から 30 である。

〔 0 0 6 9 〕

方法 A を行うには、式 (I I) の化合物 1 モル当たり、1 から 2 モル、好ましくは 1 モルのヒドロキシリルアミン (I I I) および 1 から 5 モル、好ましくは 1 モルの塩素化試薬を用いる。反応時間は 1 から 4 8 時間である。後処理は一般的な方法によって行う。必要に応じて、化合物は再結晶、蒸留もしくはクロマトグラフィーによって精製し、または事前の精製を行わずに次の段階で用いることができる。

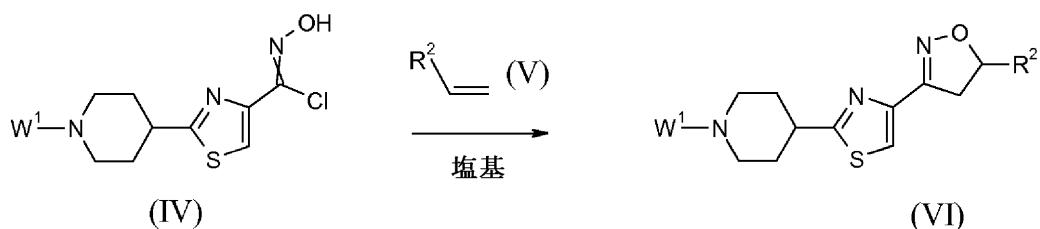
〔 0 0 7 0 〕

方法 B

図式2：方法B

[0 0 7 1]

〔化4〕



W¹ は、アセチル、C₁ - C₄ - アルコキシカルボニル、ベンジル、ベンジルオキシカルボニルまたは [3, 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチルであり、

R^2 は、少なくとも一つのプロプ-2-イン-1-イルオキシまたは一つの水酸基で置換されており、メチル、メトキシ、フルオロもしくはクロロからなる群から選択される1個、2個もしくは3個の置換基によってさらに置換されていても良いフェニルを表す。

【0072】

化合物(IV)から中間体(VI)を製造する一つの手段を図式2に示している(方法B)。

【0073】

一般式(VI)の化合物は、シクロ付加反応によって一般式(IV)のアルケンおよび化合物(V)から得られる(例えばWO 08/013622、およびSynthesis, 1987, 11, 998-1001参照)。

【0074】

アルケン(V)は市販されているか、文献に記載の方法によって市販の前駆体から製造することができる(例えばウイティッヒまたはホーナー・ワズワース・エモンズオレフィン化によってケトンまたはアルデヒドから: Chem. Rev. 1989, 89, 863-927およびジュリアオレフィン化: Tetrahedron Lett. 1973, 14, 4833-4836; ピーターソンオレフィン化: J. Org. Chem. 1968, 33, 780)。

【0075】

方法Bは、好適な塩基の存在下に行う。好ましい塩基は、3級アミン(例えばトリエチルアミン)、ならびにアルカリ金属もしくはアルカリ土類金属の炭酸塩、炭酸水素塩およびリン酸塩である。

【0076】

方法Bは、好ましくは1以上の希釈剤を用いて行う。方法Bの実施において、不活性有機溶媒が好ましい選択肢である(例えば、トルエンおよびヘキサン)。水も同様に可能な溶媒である。あるいは、方法Bは過剰のアルケン(V)中で行うことができる。

【0077】

代表的には、好適な塩基およびオレフィン(V)を最初に入れ、化合物(IV)を加える。あるいは、化合物(IV)および(V)を最初に入れ、好適な塩基を加える。

【0078】

方法Bの実施において、反応温度は比較的広い範囲内で変動し得る。概して、使用される温度は、-120から+150、好ましくは-10から+100の温度、最も好ましくは0から30である。

【0079】

方法Bを行うには、式(IV)の化合物1モル当たり0.5から5モル、好ましくは1モルのアルケン(V)を用いる。反応時間は1から48時間である。後処理は一般的な方法によって行う。必要に応じて、化合物は再結晶、蒸留もしくはクロマトグラフィーによって精製し、または事前の精製を行わずに次の段階で用いることもできる。

【0080】

方法C

図式3: 方法C

【0081】

【化5】



W¹はアセチル、C₁-C₄-アルコキシカルボニル、ベンジルまたはベンジルオキシカルボニルであり、

R²は、少なくとも一つのプロプ-2-イン-1-イルオキシまたは一つの水酸基で置換されており、メチル、メトキシ、フルオロもしくはクロロからなる群から選択される

10

20

30

40

50

個、2個もしくは3個の置換基によってさらに置換されても良いフェニルを表す。

【0082】

相当する化合物(VI)から式(VII)の化合物を製造する一つの手段を図式3に示してある。

【0083】

文献に記載の保護基を脱離させる好適な方法によって、式(VI)の化合物を式(VII)の化合物に変換する(*Protective Groups in Organic Synthesis*; Third Edition; 1999; 494-653およびそこに引用の文献)。

【0084】

tert-ブトキシカルボニルおよびベンジルオキシカルボニル保護基は酸性媒体中で脱離させることができる(例えば、塩酸またはトリフルオロ酢酸で)。アセチル保護基は、塩基性条件下で脱離させることができる(例えば、炭酸カリウムまたは炭酸セシウムで)。ベンジル保護基は、触媒の存在下に水素での水素化分解によって脱離させることができる(例えば、パラジウム/活性炭)。

【0085】

有用な溶媒は、反応条件下で不活性である全ての一般的な溶媒であり、例えばアルコール類(例えば、メタノール、エタノール、プロパノール)、環状および非環状エーテル類(例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン)、芳香族炭化水素(例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン)、ハロゲン化炭化水素(例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素)、ハロゲン化芳香族炭化水素(例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン)、ニトリル類(例えば、アセトニトリル)、カルボン酸エステル(例えば、酢酸エチル)、アミド類(例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド)、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリノン、水および酢酸であり、またはその反応は、これら溶媒の2種類以上の混合物中で行うことができる。

【0086】

t-ブトキシカルボニル基およびベンジルオキシカルボニル基の脱保護のこの反応で用いることができる酸は、例えば、トリフルオロ酢酸、塩酸または文献に記載の他の酸である(例えば *Protective Groups in Organic Synthesis*; Third Edition; 1999; pp. 494-653)。

【0087】

その反応は通常、0から+150の温度で、そして好ましくは室温で行うが、それは反応混合物の還流温度で行うこともできる。反応時間は反応の規模および反応温度の関数として変動とするが、通常は1/2時間から72時間である。

【0088】

反応が終了した後、化合物(VII)を、一般的な分離技術の一つによって反応混合物から分離する。必要に応じて、化合物は再結晶、蒸留もしくはクロマトグラフィーによって精製し、または所望に応じて、事前の精製を行わずに次の段階で用いることもできる。一般式(VII)の化合物を塩として、例えば塩酸またはトリフルオロ酢酸の塩として単離することも可能である。

【0089】

方法D

図式4：方法D

【0090】

10

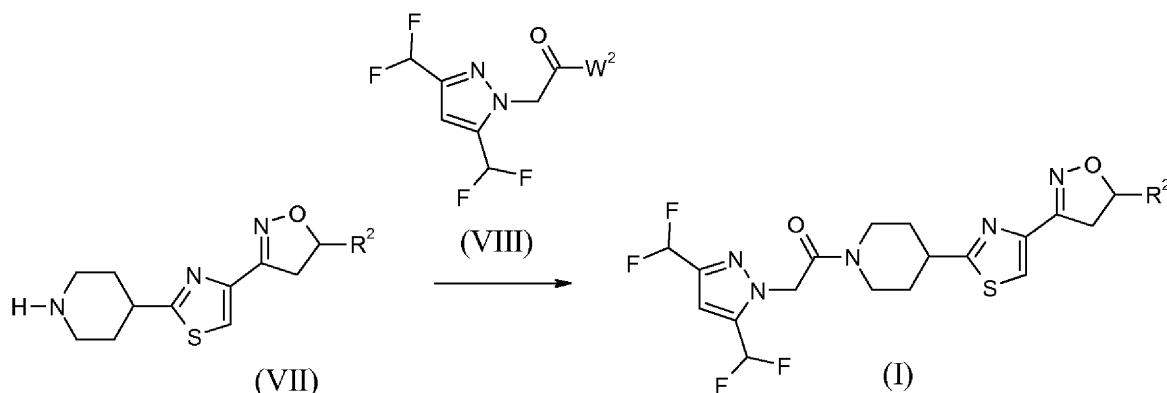
20

20

30

40

【化6】



10

W^2 は塩素または OH であり、

R^2 は、少なくとも一つのプロブ - 2 - イン - 1 - イルオキシまたは一つの水酸基で置換されており、メチル、メトキシ、フルオロもしくはクロロからなる群から選択される 1 個、2 個もしくは 3 個の置換基によってさらに置換されていても良いフェニルを表す。

【0091】

相当する化合物 (VII) から式 (I) の化合物を製造する一つの手段を図式 4 に示してある。

【0092】

一般式 (I) を有する化合物は、文献に記載の方法と同様にして (例えば WO 07/147336 を参照)、適宜に酸捕捉剤 / 塩基の存在下での相当する一般式 (VII) を有する化合物の一般式 (VIIa) (W^2a = 塩素) の基質とのカップリング反応によって合成することができる。

【0093】

化合物 (VIIa) (W^2a = 塩素) または (VIIb) (W^2b = OH) は市販されているか、文献に記載の方法によって製造することができる (例えば、WO 08/013622 および WO 08/013925 参照)。さらに、 W^2a = 塩素である一般式 (VIIa) を有する基質は、文献から公知の方法を用いる塩素化によって相当する酸 (W^2b = OH) から製造することができる (例えば、Tetrahedron 2005, 61, 10827 - 10852 およびそこに引用の文献)。

【0094】

使用される溶媒は、反応条件下で不活性である全ての一般的な溶媒であることができ、例えば環状および非環状エーテル類 (例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン)、芳香族炭化水素 (例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン)、ハロゲン化炭化水素 (例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素)、ハロゲン化芳香族炭化水素 (例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン) およびニトリル類 (例えば、アセトニトリル) であり、またはその反応はこれら溶媒のうちの 2 種類以上の混合物中で行うことができる。好ましい溶媒はテトラヒドロフランおよびジクロロメタンである。

【0095】

一般式 (VII) の原料に対して少なくとも 1 当量の酸捕捉剤 / 塩基 (例えばヒュニッヒ塩基、トリエチルアミンまたは市販のポリマー酸捕捉剤) を用いる。原料が塩である場合、少なくとも 2 当量の酸捕捉剤が必要である。

【0096】

その反応は通常、0 から 100 、好ましくは 20 から 30 の温度で行うが、それは反応混合物の還流温度で行うことのできる。反応時間は、反応規模および反応温度の関数として変動するが、一般的には数分から 48 時間である。

【0097】

反応終了後、通常の分離技術の一つによって、反応混合物から化合物 (I) を分離する。必要に応じて、化合物は再結晶、蒸留もしくはクロマトグラフィーによって精製し、ま

20

30

40

50

たは事前の精製を行わずに次の段階で用いることもできる。

【0098】

あるいは、式(I)の化合物は、文献に記載の方法(例えば、*Tetrahedron* 2005, 61, 10827-10852およびそれに引用の参考文献)と同様にしてカップリング試薬の存在下にW²^b=OHである式(VIIIb)の基質を用いて、式(VII)の相当する化合物から合成することもできる。

【0099】

好適なカップリング試薬は、例えば、ペプチドカップリング試薬(例えばN-(3-ジメチルアミノプロピル)-N'-エチルカルボジイミドと4-ジメチルアミノピリジンとの混合物、N-(3-ジメチルアミノプロピル)-N'-エチルカルボジイミドの1-ヒドロキシベンゾトリアゾールとの混合物、ヘキサフルオロリン酸プロモトリピロリジノホスホニウム、ヘキサフルオロリン酸O-(7-アザベンゾトリアゾール-1-イル)-N,N,N'-テトラメチルウロニウムなど)である。

10

【0100】

適切な場合、塩基、例えばトリエチルアミンまたはヒューニッヒ塩基をその反応で用いることができる。

【0101】

R²におけるヒドロキシ置換基は、反応が起こる合成の全ての段階で当業者に一般的な知識である反応方法によって修飾することができる。例えば、好適なハライドまたはサルフェートを用いて公知の方法によって、OH官能基をアルキル化することができる(例えば、J. March: *Advanced Organic Chemistry - Reactions, Mechanisms and Structures*, 4th Ed. (1992), Wiley, New York, pp. 388-390, 406-407, 411-415参照)。そのような反応の例は、本願の合成の部にある。

20

【0102】

使用される溶媒は、反応条件下では不活性である全ての一般的な溶媒であることができ、例えばアルコール類(例えば、メタノール、エタノール、プロパノール)、環状および非環状エーテル類(例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン)、芳香族炭化水素(例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン)、ハロゲン化炭化水素(例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素)、ハロゲン化芳香族炭化水素(例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン)、ニトリル類(例えば、アセトニトリル)およびアミド類(例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド)であり、またはその反応は、これら溶媒のうちの2種類以上の混合物中で行うことができる。好ましい溶媒はジクロロメタンである。

30

【0103】

その反応は通常、0から100、好ましくは0から30の温度で行うが、それは反応混合物の還流温度で行うこともできる。反応時間は、反応の規模および反応温度の関数として変動するが、一般的には数分から48時間である。

40

【0104】

反応終了後、化合物(I)は、一般的な分離技術の一つによって反応混合物から分離される。必要に応じて、化合物は再結晶、蒸留もしくはクロマトグラフィーによって精製し、または事前の精製を行わずに次の段階で用いることができる。

【0105】

本発明はさらに、本発明による活性化合物組み合わせを含む望ましくない微生物を駆除/防除するための組成物に関するものもある。好ましくは、当該組成物は、農業的に好適な補助剤、溶媒、担体、界面活性剤または增量剤を含む殺菌剤組成物である。

【0106】

さらに本発明は、本発明による活性化合物組み合わせを植物病原性真菌および/またはそれらの棲息場所に施用することを特徴とする、望ましくない微生物を駆除する方法に関

50

するものである。

【0107】

本発明によれば、担体は、特に植物もしくは植物部分または種子への施用に関して、より良好な施用性を得るために、活性化合物と混合または組み合わせる天然または合成の有機物質または無機物質である。その担体は、固体または液体であることができ、一般に不活性であり、そして、農業での使用に好適であるべきである。

【0108】

好適な固体または液体担体は、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粉碎鉱物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粉碎合成鉱物、樹脂類、ロウ類、固体肥料、水、アルコール類、特別にはブタノール、有機溶媒、鉱油および植物油、ならびにそれらの誘導体である。そのような担体の混合物を用いることも可能である。粒剤に好適な固体担体は、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鉱物ならびに無機および有機粉末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である。

10

【0109】

好適な液化ガス增量剤または担体は、環境温度および大気圧下では気体である液体、例えば、エアロゾル噴射剤、例えばブタン、プロパン、窒素および二酸化炭素である。

【0110】

上記製剤において、粘着付与剤、例えば、カルボキシメチルセルロースならびに粉末、顆粒またはラテックスの形態にある天然ポリマーおよび合成ポリマー、例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、ポリ酢酸ビニル、または、天然のリン脂質、例えばセファリン類およびレシチン類、および合成リン脂質などを使用することができる。他の可能な添加剤は、鉱油および植物油およびロウ類であり、それらは変性されていても良い。

20

【0111】

使用される增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。好適な液体溶媒は、実質的に、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、クロロベンゼン類、クロロエチレン類または塩化メチレンなどの塩素化芳香族化合物もしくは塩素化脂肪族炭化水素、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類、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、ならびに水である。

30

【0112】

本発明による組成物は、例えば界面活性剤などのさらに別の成分を含むことができる。好適な界面活性剤は、乳化剤、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。その例は、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類のリン酸エステル、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である。活性化合物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、本発明による組成物の5から40重量%である。

40

【0113】

無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタンおよびブルシャンブルーなどの着色剤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

50

能である。

【0114】

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、活性化合物は、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。

【0115】

概して、本発明による組成物は、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%、特に好ましくは0.5から90%の本発明による活性化合物組み合わせを、非常に特に好ましくは10から70重量%を含む。

10

【0116】

本発明による活性化合物組み合わせまたは組成物は、そのまま用いることができるか、それらの個々の物理的および/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調製される使用形態で用いることができ、例えばエアロゾル、カプセル懸濁液、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、サスペンション濃縮液、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、天然物および活性化合物を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。

20

【0117】

言及した製剤は、自体公知の方法で、例えば活性化合物もしくは活性化合物の組み合わせを少なくとも1種類の添加剤と混合することで製造することができる。好適な添加剤は、例えば有機溶媒、增量剤、溶媒もしくは希釈剤、固体担体および充填剤、界面活性剤(補助剤、乳化剤、分散剤、保護コロイド、湿展剤および粘着付与剤など)、分散剤および/または結合剤または固定剤、保存剤、色素および顔料、消泡剤、無機および有機増粘剤、撥水剤、適切な場合には乾燥剤およびUV安定化剤、ジベレリン類および水およびさらに別の加工補助剤などの全ての一般的な製剤補助剤である。各場合で製造される製剤の種類に応じて、例えば湿式粉碎、乾式粉碎または造粒などのさらなる加工段階が必要となる可能性がある。

30

【0118】

本発明による組成物は、植物または種子に好適な装置で施用することができる即時使用の組成物だけでなく、使用前に水で希釈すべき商業用の濃縮物も含むものである。

【0119】

本発明による活性化合物の組み合わせは、(商業的)製剤で、そして殺虫剤、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、薬害軽減剤および情報物質などの他の(公知の)活性化合物との混合物として、これら製剤から調製された使用形態で存在させることができる。

40

【0120】

活性化合物または組成物による植物および植物部分の本発明による処理は、一般的な処理方法を用い、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、そして繁殖植物の場合、特に種子の場合はさらに乾式種子処理用粉末、種子処理用溶液、スラリー処理用水溶性粉末として、被覆により、1以上の層によるコーティングによる等で、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。超微量法によって活性化合物を施用するか、活性化合物の製剤もしくは活性化合物自体を土壤に注入することも可能である。

【0121】

50

本発明はさらに、種子の処理方法を含む。本発明はさらに、前の段落に記載の方法のうちの一つに従って処理された種子に関するものもある。

【0122】

本発明による活性化合物または組成物は、種子の処理に特別に適している。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。

【0123】

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。従って、植物の播種後もしくは発芽後の作物保護剤の追加施用を行わずに済ますか、少なくとも追加施用を大幅に減らす、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活性化合物の量を最適化することで、使用される活性化合物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最大限保護することがさらに望ましい。特に、種子の処理方法では、使用する作物保護剤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ために、遺伝子組み換え植物の固有の殺菌特性も考慮すべきである。

10

20

【0124】

従って本発明は特に、本発明による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性真菌による攻撃から保護する方法に関するものもある。本発明はさらに、植物病原性真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までの本発明による組成物の使用に関するものもある。さらに本発明は、植物病原性真菌に対する保護のために本発明による組成物で処理した種子に関するものもある。

30

【0125】

発芽後に植物に損傷を与える植物病原性真菌の防除は、主として土壤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、施用される活性化合物の量を減らすための努力がなされている。

30

【0126】

本発明の利点の一つは、本発明による組成物の特定の浸透性のために、これら組成物による種子の処理は、植物病原性真菌から、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すことができる。

40

【0127】

本発明による混合物を特に、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による活性化合物の組み合わせもしくは組成物で処理することで、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。

【0128】

本発明による組成物は、農業、温室、森林、造園または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、ライ麦、ライ小麦、キビ、カラス麦など）、トウモロコシ（コーン）、棉、大豆、イネ、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

50

植物（下記も参照）の種子の形態を取る。穀類（小麦、大麦、ライ麦、ライ小麦、カラス麦など）、トウモロコシ（コーン）およびイネの処理が特に重要である。

【0129】

下記でもさらに述べるように、本発明による活性化合物の組み合わせまたは組成物を用いて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を指すものである。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*）、シュードモナス種（*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、その遺伝子産物はヨーロピアンコーンボーラー（European corn borer）および／またはウェスタンコーンルートワーム（Western corn rootworm）に対する活性を有する。特に好ましくは、異種遺伝子はバチルス・トウリンギエンシス（*Bacillus thuringiensis*）由来である。

10

【0130】

本発明との関連で、本発明による活性化合物の組み合わせまたは組成物は、それ自体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、それが十分に安定であることで、その処理が損傷を生じない状態で処理する。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。通常、使用する種子は植物から分離され、穂軸、殻、茎、外被、毛または果実の実を含まない。従って、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。

20

【0131】

種子を処理する場合、種子に施用される本発明による組成物の量および／または別の添加剤の量を、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効果を有し得る活性化合物の場合には特に留意すべきである。

30

【0132】

本発明による組成物は直接施用することができる、すなわち別の成分を含んだり、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できる。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U.S.4,272,417A、U.S.4,245,432A、U.S.4,808,430A、U.S.5,876,739A、U.S.2,003/017,642,8A1、WO 2002/080675A1、WO 2002/028186A2に記載されている。

30

【0133】

本発明に従って使用することができる活性化合物の組み合わせは、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材料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。

40

【0134】

これらの製剤は、公知の方法で、活性化合物または活性化合物の組み合わせを例えば、一般的な增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、着色剤、湿展剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、保存剤、二次増粘剤、接着剤、ジベレリン類および水と混合することで製造される。

【0135】

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好適な着色剤には、そのような目的に一般的な全ての着色剤が含まれる。水溶解度が小さい顔料と水に可溶な色素の両方を用いることができる。言及することができる例には、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

50

る着色剤などがある。

【0136】

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好適な湿展剤には、濡れを促進し、活性な農芸化学物質の製剤で一般的な全ての物質が含まれる。好ましくは、アルキルナフタレン-スルホネート類、例えばスルホン酸ジイソプロピルもしくはジイソブチルナフタレンを用いることが可能である。

【0137】

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好適な分散剤および／または乳化剤には、活性農芸化学物質の製剤で一般的な全てのノニオン系、アニオン系およびカチオン系の分散剤が含まれる。好ましくは、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を用いることが可能である。特に好適なノニオン系分散剤は、エチレンオキサイド-プロピレンオキサイ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である。特に好適なアニオン系分散剤は、リグノスルホネート類、ポリアクリル酸塩およびアリルスルホネート-ホルムアルデヒド縮合物である。

10

【0138】

本発明に従って用いられ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、活性農芸化学物質の製剤で一般的な全ての発泡阻害化合物などがある。好ましくは、シリコーン系消泡剤、ステアリン酸マグネシウム、シリコーン系乳濁液、長鎖アルコール類、脂肪酸類およびそれらの塩、そして有機フッ素化合物およびこれらの混合物を用いる。

20

【0139】

本発明に従って使用され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化合物が含まれる。例として、ジクロロフェンおよびベンジルアルコールヘミホルマールを挙げることができる。

20

【0140】

本発明に従って使用され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化合物が含まれる。セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサンタンガムもしくはVeegumなどの多糖類、改質粘土、アタパルガイトおよびベントナイトなどのフィロケイ酸塩、および微粉碎ケイ酸が好ましい。

30

【0141】

本発明に従って使用される種子被覆製剤中に存在させることができる好適な接着剤には、種子被覆で使用可能な全ての一般的な結合剤が含まれる。ポリビニルピロドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコールおよびチロースを好ましいものとして挙げることができる。

【0142】

本発明に従って使用される種子被覆製剤中に存在させることができる好適なジベレリン類は、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、特に好ましいものはジベレリン酸である。ジベレリン類は公知である(R. Wegler

40

Chemie der Pflanzenschutz- und Schaedlingsbekämpfungsmittel [Chemistry of Crop Protection Agents and Pesticides], Vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412参照)。

【0143】

本発明に従って用いることができる種子被覆製剤は、直接または事前に水で希釈した後に、非常に多様な種類のいずれかの種子を処理することができる。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その希釈製剤を用いて、遺伝子組み換え植物の種子を被覆することもできる。これに関連して、発現によって形成される物質との相互作用において、相乗効果が生じる可能性もある。

50

【0144】

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ための好適な混合装置には、被覆に一般に使用することができる全ての混合装置が含まれる。被覆時に採用される具体的な手順は、種子を混合機に導入する段階、特に望ましい量の種子被覆製剤をそのまままたは事前に水で希釈した後に加える段階、および製剤が種子上に均一に分布するまで混合を行う段階を含む。適宜に、続いて乾燥操作を行う。

【0145】

本発明による活性化合物又は組成物は、強力な殺微生物活性を有しており、作物保護と材料物質の保護において、菌類及び細菌類などの望ましくない微生物を防除するために使用することができる。

10

【0146】

作物保護において、殺菌剤は、ネコブカビ類(*Plasmidiophoromycetes*)、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*)及び不完全菌類(*Deuteromycetes*)を防除するために、使用することができる。

【0147】

作物保護において、殺細菌剤は、シュードモナス科(*Pseudomonadaceae*)、リゾビウム科(*Rhizobiaceae*)、腸内細菌科(*Enterobacteriaceae*)、コリネバクテリウム科(*Corynebacteriaceae*)及びストレプトミセス科(*Streptomycetaceae*)を防除するために、使用することができる。

20

【0148】

本発明による殺菌剤組成物は、植物病原性菌類を治療的又は保護的に防除するために使用することができる。従って、本発明は、本発明による活性化合物組合せ又は組成物を使用して植物病原性菌類を防除するための治療的方法又は保護的方法にも関し、ここで、該活性化合物組合せ又は組成物は、種子、植物若しくは植物の部分、果実又は植物がそこで成育している土壤に施用される。好ましくは、植物若しくは植物の部分、果実又は植物がそこで成育している土壤に施用する。

30

【0149】

作物保護における植物病原性真菌を駆除するための本発明による組成物は、活性だが非植物毒性の量の本発明による化合物を含む。「活性だが、非植物毒性の量」とは、真菌によって引き起こされる植物病害を防除または完全死滅させる上で十分であり、かつ、同時に、植物毒性の顕著な症状を示さない本発明による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り、それはいくつかの因子、例えば植物病原性真菌、植物もしくは作物、気候条件および本発明による組成物の成分によって決まる。

【0150】

活性化合物が、植物疾患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、栄養繁殖植物および種子、ならびに土壤の処理を行うことができる。

40

【0151】

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。ここで、植物とは、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と理解すべきである。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、植物品種保護権利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植物のあらゆる地上および地下の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、茎、幹、花、子実体、果実および種子、そ

50

して根、塊茎および地下茎を挙げることができる。植物部分には、収穫物ならびに栄養増殖物および生殖増殖物、例えば、苗、塊茎、地下茎、切り枝および種子などもある。好ましいものは、植物ならびに植物の地上部分および地下部分および器官、例えば苗条、葉、花および根などの処理であり、挙げることができる器官の例には、葉、針葉、茎、幹、花および果実がある。

【0152】

良好な植物耐性および温血動物に対する好ましい毒性を併せ持ち、環境によって良好に耐容される本発明の活性化合物は、植物および植物の器官を保護するのに適しており、収穫高を増大させるのに適しており、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、作物保護剤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一部の段階に対しても活性である。

10

【0153】

下記の植物を、本発明に従って処理可能である植物として挙げることができる。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、梨果果実、例えばリンゴおよびナシだけでなく、石果果実、例えば、アンズ、サクランボ、アーモンドおよびモモおよび柔らかい果物、例えばイチゴ）、リベシオイダエ科属種(*Ribesioiidae* sp.)、クルミ科属種(*Juglandaceae* sp.)、カバノキ科属種(*Betulaceae* sp.)、ウルシ科属種(*Anacardiaceae* 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(*Actinidiaceae* 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、カラスムギ、キビおよびライコムギなどの穀物）、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、ハツカダイコン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、エンドウ豆、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作物および観賞用植物；ならびに各場合で、これらの植物の遺伝子改变品種である。

20

【0154】

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できる。好ましい実施形態では、野生の植物種ならびに交配またはプロトプラスト融合のような従来の生物育種法によって得られる植物栽培品種、ならびにそれらの部分が処理される。さらに好ましい実施形態では、適切な場合は従来の方法と組み合わせた遺伝子工学法によって得られたトランスジェニック植物および植物品種（遺伝的改变生物）、ならびにこれらの部分を処理する。「部分」、「植物の部分」および「植物部分」という用

30

40

50

語については、すでに上記で説明している。特に好ましくは、各場合において、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性（「形質」）を有する植物を意味するものと理解すべきである。これらは、栽培品種、生物型または遺伝子型であることができる。

【0155】

本発明による処理方法は、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される。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低下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RNA干渉 - RNAi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定の位置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。

【0156】

植物種または植物品種、それらの場所および成長条件（土壤、天候、生育期間、栄養）によっては、本発明による処理は、超加算的（「相乗」）効果をもたらすこともある。従って、例えば、実際に起こると予想される効果を超える次の効果：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活性化合物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壤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、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。

【0157】

一定の施用量では、本発明による活性化合物の組み合わせは、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も適している。これは、適切な場合には、例えば真菌に対する本発明による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（抵抗性誘導性）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および/または微生物および/またはウィルスを接種された場合に、処理される植物が、かなりの程度のこれら望ましくない植物病原菌および/または微生物および/またはウィルス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、本発明による物質は、処理後のある一定の時間内に、上記病原体による攻撃に対して植物を保護するのに使用できる。保護が有効となる期間は、活性化合物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。

【0158】

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。

【0159】

やはり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は、1以上の生物ストレス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示す。

【0160】

10

20

30

40

50

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、土壤塩濃度上昇、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、日陰の忌避などがあり得る。

【0161】

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、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、その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、苗の元気、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が、これらに限定されるものではない。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。

【0162】

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雑種強勢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（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、雄性不稔性は、植物ゲノムにおける遺伝的決定基の結果である。この場合、そして特には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、ハイブリッド植物での雄性不稔性が十分に回復されるようにすることが有用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ようにすることで達成される。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（C M S）の例としては、例えばアブラナ属種に記載されていた。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、W O 8 9 / 1 0 3 9 6 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。

【0163】

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。

【0164】

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。植物は、各種手段によってグリホセートに対して耐性とすることができます。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（E P S P S）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E P S P S 遺伝子の例は、細菌サルモネラ・チフィムリウム（*S a l m o n e l l a t y p h i m u r i u m*）のA r o A 遺伝子（突然変異C T 7）、細菌アグロバクテリウム属種（*A g r o b a c t e r i u m*

10

20

30

40

50

m s p) の C P 4 遺伝子、ペチュニア E P S P S 、トマト E P S P S もしくはオヒシバ (E l e u s i n e) E P S P S をコードする遺伝子である。それは、変異 E P S P S 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。

【 0 1 6 5 】

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、例えばビアラホス、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、ホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼ (Streptomyces (S t r e p t o m y c e s) 種からの b a r または p a t 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。

【 0 1 6 6 】

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 (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、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。

【 0 1 6 7 】

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、ピリミジニルオキシ (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、W O 1 9 9 6 / 0 3 3 2 7 0 に記載されている。他のイミダゾリノン耐性植物も記載されている。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W O 2 0 0 7 / 0 2 4 7 8 2 に記載されている。

【 0 1 6 8 】

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、例えば大豆、イネ、サトウダイコン、レタスまたはヒマワリについて記載の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。

【 0 1 6 9 】

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。

【 0 1 7 0 】

10

20

30

40

50

本明細書で使用される場合に「昆虫耐性トランスジェニック植物」とは、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。

【0171】

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_Cricke.more/Bt/ にオンラインで挙げ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Cryタンパク質分類Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry2Ab、Cry3AaまたはCry3Bbのタンパク質またはそれらの殺虫性部分；または

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由来の第二の他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れの部分、例えばCry34およびCry35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(corn event)MON98034により產生されるCry1A.105タンパク質(WO2007/027777)；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に導入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；

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_Cricke.more/Bt/vip.htmlで列挙される植物殺虫性(VIP)タンパク質、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；または

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に導入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1)から3)のいずれかのタンパク質(なおも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。

【0172】

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、異なる標的昆虫種に向けた異なるタンパク質を用いる場合に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

10

20

30

40

50

ードする複数のトランス遺伝子を含む。

【0173】

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。

【0174】

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. ニコチニアミダーゼ、ニコチネートホスホリボシルトランスフェラーゼ、ニコチニ酸モノスクレオチドアデニルトランスフェラーゼ、ニコチニアミドアデニンジスクレオチド合成酵素またはニコチニ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ニアミドアデニンジスクレオチドサルベージ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。

【0175】

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、収穫物の量、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。

【0176】

1) 物理化学的特性において、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、ゲル化強度、デンプン粒度および／またはデンプン粒子形態に関して、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、これが特別な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产生する植物、 - 1, 4 - グルカン類を产生する植物、 - 1, 6 - 分枝 - 1, 4 - グルカン類を产生する植物、アルテルナンを产生する植物がある。

【0177】

3) ヒアルロンを产生するトランスジェニック植物。

【0178】

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、纖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纖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。

【0179】

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rsw2またはrsw3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) 纖維細胞の根底での原形質連絡制御のタイミングが、例えば纖維選択的 - 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nodCなどのN-アセチルグルコサミントランスフェラーゼ遺伝子およびキチン合成遺伝子の発現により、反応性が変わった纖維を有するワタ植物などの植物。

【0180】

10

20

30

40

50

やはり本発明によって処理づ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ることができる）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（Brassica）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が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。

【0181】

- a) 高いオレイン酸含有量を有する油を產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產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產生するセイヨウアブラナ植物などの植物。

【0182】

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、それには例えば、商品名YIELD GARD（登録商標）（例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ）、Knock Out（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Bite Guard（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Bt-Xtra（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、StarLink（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Bolgard（登録商標）（ワタ）、Nucotn（登録商標）（ワタ）、Nucotn 33B（登録商標）（ワタ）、NatureGuard（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Protecta（登録商標）およびNewLeaf（登録商標）（ジャガイモ）で販売されているものである。挙げることができる除草剤耐性植物の例には、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STS（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。挙げができる除草剤耐性植物（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）（例えばトウモロコシ）で販売されている品種などがある。

【0183】

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_browse.aspxおよび<http://www.agbios.com/dbase.php>を参照する）。

【0184】

材料保護において、本発明の物質を、望ましくない真菌および/または微生物による侵襲および破壊に対して技術材料を保護するのに用いることができる。

【0185】

本発明の文脈で技術材料は、工業用に作られた非生物材料と理解される。例えば、本発明の活性材料によって微生物による変化または破壊から保護されるべき技術材料は、接着剤、糊、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侵襲もしくは破壊を受け得る他の材料であることができる。保護すべき材料の文脈の範囲内には、真菌および/または微生物の繁殖によって害を受け得る製造工場および建造物の一部、例えば冷却水循環路、冷却および加熱システム、空調および換気システムもある。本発明の文脈の範囲内で、工業材料として好みしく挙げられるものは、接着剤、糊、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、特に好みしいものは木材である。本発明による組み合わせは、劣化、退色および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。同様に、本発明による活性化合物組み合わせおよび組成物は、対象物、特に海水または汽水と接触する船舶の船体、篩、ネット、建築物、突堤および信号装置をコロニー形成に対して保護するのに用いることができる。

10

20

30

40

50

【0186】

本発明による処理方法は、真菌および微生物の攻撃に対して貯蔵品を保護する分野でも用いることができる。本発明によれば、「貯蔵品」という用語は、自然のライフサイクルから取られた、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その加工形態を指すものと理解される。植物もしくは植物部分、例えば茎、葉、塊茎、種子、果実もしくは穀粒などの植物由来の貯蔵品は、収穫されたばかりで、または前乾燥、加湿、破碎、粉碎、加圧または焙焼などの加工形態後に保護することができる。貯蔵品の定義には、建築用材木、電柱および柵などの粗材木または家具もしくは木材製品などの完成製品の形態のいずれであっても材木も含まれる。動物由来の貯蔵品は、獣皮、皮革、毛皮、毛髪などである。本発明による組み合わせは、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。好ましくは「貯蔵品」は、植物由来の天然物質およびその加工形態、より好ましくは果実およびその加工形態、例えば仁果、核果、軟果実および柑橘類およびそれらの加工形態を指すものと理解される。

【0187】

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をいくつか、例として挙げることができるが、それに限定されるものではない。

【0188】

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phaエラ・ロイコトリカ (*Podosphaera leucotricha*)などのポドスphaエラ (*Podosphaera*)種；スphaエロセカ・フリギネア (*Sphaerotheca fuliginea*)などのスphaエロセカ (*Sphaerotheca*)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 pachyrhizici*)およびファコプソラ・マイボミアエ (*Phakopsora meibomiae*)などのファコスブソラ (*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 triticina*)などのプッシニア (*Puccinia*)種；ウロミセス・アップエンディキュラタス (*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 pisii*)またはP. ブラッシカエ (*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；プラスモバラ・ビチコラ (*Plasmopara viticola*)などのプラスモバラ (*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 disease*s)および葉萎凋病 (*leaf wilt disease*s)、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

10

20

30

40

50

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 (*Cladiosporium cucumerinum*) などのクラジオスポリウム (*Cladiosporum*) 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：ヘルミントスボリウム (*Helminthosporium*)) などのコクリオボラス (*Cochliobolus*) 種；コレトトリカム・リンデムサニウム (*Collectotrichum lindemuthianum*) などのコレトトリカム (*Collectotrichum*) 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；グレオスボリウム・ラエティカラ (*Gloeosporium laeticolor*) などのグレオスボリウム種 (*Gloeosporium*)；グロメレラ・シンギュラータ (*Glomerella cingulata*) などのグロメレラ (*Glomerella*) 種；ギニヤルディア・ビドウェリ (*Guignardia bidwellii*) などのギニヤルディア (*Guignardia*) 種；レプトスファエリア・マキュランス (*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；リンコスボリウム・セカリス (*Rhynchosporium secalis*) などのリンコスボリウム (*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；

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・オキシスボラム (*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；

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；クラドスボリウム・クラドスボリオイデス (*Cladosporium cladosporioides*) などのクラドスボリウム (*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;

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. contortorum* (*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;

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 alboatrum*) 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壤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; フイトフソラ・カクトラム (*Phytophthora cactorum*) などのフイトフソラ (*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 rolfsii*) などのスクレロティウム (*Sclerotium*) 種;

以下のものによって引き起こされる癌性病、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・デフォルマンス (*Taphrina deformans*) などのタフリナ (*Taphrina*) 種;

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・クラミドスボラ (*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; ヘルミントスボリウム・ソラニ (*Helminthosporium solani*) などのヘルミントスボリウム (*Helminthosporium*) 種;

10

20

30

40

50

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 p.v. オリザエ (*Xanthomonas campesiris* p.v. *oryzae*) などのキサントモナス (*Xanthomonas*) 種; シュードモナス・シリングエ p.v. ラクリマンス (*Pseudomonas syringae* p.v. *lachrymans*) などのシュードモナス (*Pseudomonas*) 種; エルウェイニア・アミロボラ (*Erwinia amylovora*) などのエルウェイニア (*Erwinia*) 種。

【0189】

下記の大豆病害を防除することが好ましい。

【0190】

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. atrans tenuissima*))、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 gloeosporoide dematum* var. *truncatum*))、褐斑病 (brown spot) (セプトリア・グリシネス (*Septoria glycines*))、セルコスボラ葉斑点病 (*Cercospora leaf spot*) および焼枯れ病 (blight) (セクロスボラ・キクチイ (*Cercospora kikuchii*))、コア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・トリスピラ (*Choanephora infundibulifera trispore*) (同義))、ダクチュリオフォラ葉斑点病 (*Dactuliothora leaf spot*) (ダクチュリオフォラ・グリシネス (*Dactuliothora glycines*))、ベと病 (downy mildew) (ペロノスピラ・マンシリカ (*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 (*Phyllosticta 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 (*Pyrenopeziza leaf spot*) (ピレノチャエタ・グリシネス (*Pyrenopeziza 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 meidomiiae*))、黒星病 (スファセロマ・グリシネス (*Sphaeloma 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 botrys*))、輪紋病 (コリネスボラ・カッシイコラ (*Corynespora cassiicola*))。

【0191】

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 (*Macrop homina phaseolina*))、フザリウム焼枯病 (*Fusarium bl*

10

20

30

40

50

ight) または萎凋病 (wilt) 、根腐れ病ならびに鞘および頸部腐れ病 (root) (フザリウム・オキシスポラム (*Fusarium oxy sporum*) 、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・エクイセチ (*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*)) 、ネオコスモスボラ (*neocosmospora*) (ネオコスモスボラ・バスインフェクタ (*Neocosmospora vas infecta*)) 、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. caulinivora*)) 、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・アファニデルマタム (*Pythium aphanidermatum*) 、ピチウム・イレギュラーレ (*Pythium irregulae*) 、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 (*Pythium 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*))。

【0192】

上記微生物の抵抗性株を防除することも可能である。

【0193】

工業材料を劣化又は変化させることができる微生物として挙げることができるものは、例えば、細菌類、菌類、酵母類、藻類及び粘菌類 (*slime organisms*) などである。本発明の活性化合物は、好ましくは、菌類、特に、カビ類、材木を変色させる菌類及び材木を破壊する菌類 (担子菌類 (*Basidiomycetes*)) 、並びに、粘菌類及び藻類に対して作用する。以下の属の微生物を例として挙げることができる: 例えば、アルテルナリア・テヌイス (*Alternaria tenuis*) などのアルテルナリア (*Alternaria*) ; 例えば、アスペルギルス・ニゲル (*Aspergillus niger*) などのアスペルギルス (*Aspergillus*) ; 例えば、カエトミウム・グロボスム (*Chaetomium globosum*) などのカエトミウム (*Chaetomium*) ; 例えば、コニオホラ・プエタナ (*Coniophora puetana*) などのコニオホラ (*Coniophora*) ; 例えば、レンチヌス・チグリヌス (*Lentinus tigrinus*) などのレンチヌス (*Lentinus*) ; 例えば、ペニシリウム・グラウクム (*Penicillium glaucum*) などのペニシリウム (*Penicillium*) ; 例えば、ポリポルス・ベルシコロル (*Polyporus versicolor*) などのポリポルス (*Polyporus*) ; 例えば、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*) ; 例えば、スクレロホマ・ピチオフィラ (*Sclerophoma pityophila*) などのスクレロホマ (*Sclerophoma*) ; 例えば、トリコデルマ・ビリデ

10

20

30

40

50

(*Trichoderma viride*)などのトリコデルマ(*Trichoderma*)；例えば、エシェリキア・コリ(*Escherichia coli*)などのエシェリキア(*Escherichia*)；例えば、シュードモナス・アエルギノサ(*Pseudomonas aeruginosa*)などのシュードモナス(*Pseudomonas*)；及び、例えば、スタフィロコッカス・アウレウス(*Staphylococcus aureus*)などのスタフィロコッカス(*Staphylococcus*)。

【0194】

さらに、本発明による式(I)で表される化合物は、極めて優れた抗真菌活性も示す。それらは、極めて広い抗真菌活性スペクトルを有しており、特に、皮膚糸状菌、並びに、酵母菌、カビ及び二相性真菌類に対して〔例えば、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*)などのカンジダ属各種(*Candida species*)に対して〕、並びに、エピデルモフィトン・フロコスム(*Epidermophyton floccosum*)、例えば、アスペルギルス・ニゲル(*Aspergillus niger*)及びアスペルギルス・フミガタス(*Aspergillus fumigatus*)などのアスペルギルス属各種(*Aspergillus species*)、例えば、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属各種(*Trichophyton species*)、例えば、ミクロスボロン・カニス(*Microsporon canis*)及びミクロスボロン・アウドウイニイ(*Microsporon audouinii*)などのミクロスボロン属各種(*Microsporon species*)などに対して、極めて広い抗真菌活性スペクトルを有している。これら菌類のリストは、包含され得る真菌スペクトルを決して限定するものではなく、単に例示のためのものである。

【0195】

本発明による化合物を施用する場合、その施用量は、広い範囲内で変えることができる。本発明による処理方法において通常施用される活性化合物の薬量／施用量は、一般に、及び、有利には、以下のとおりである：

・ 植物の部分、例えば、葉を処理する場合(茎葉処理)：0.1～10,000g/ha、好ましくは、10～1,000g/ha、さらに好ましくは、50～300g/ha；灌注施用又は滴下施用の場合、特に、ロックウール又はパーライトなどの不活性底土を用いる場合は、上記薬量はさらに低減させることができる；

・ 種子処理の場合：種子100kg当たり2～200g、好ましくは、種子100kg当たり3～150g、さらに好ましくは、種子100kg当たり2.5～25g、一層さらに好ましくは、種子100kg当たり2.5～12.5g；

・ 土壌処理の場合：0.1～10,000g/ha、好ましくは、1～5,000g/ha。

【0196】

本明細書中に示されている薬量は、本発明による方法を例証する例として挙げられている。当業者は、特に処理対象の植物又は作物の種類に照らして、当該施用薬量を適合させる方法を知るであろう。

【0197】

本発明による組合せは、処理後ある一定の期間、病害虫(pest)及び／又は植物病原性菌類及び／又は微生物類に対して植物を保護するために用いることができる。保護が有効となる期間は、植物が該組合せで処理されてから、一般に、1～28日間、好ましくは、1～14日間、さらに好ましくは、1～10日間、一層さらに好ましくは、1～7日間にわたり、又は、植物の繁殖器官が処理されてから、最大で200日間にわたる。

【0198】

さらに、本発明による組み合わせおよび組成物を用いて、植物および収穫された植物材料、従ってそれから製造された食品および動物飼料におけるマイコトキシンの含有量を減らすこともできる。特には、下記のマイコトキシン：デオキシニバレノール(DON)、

10

20

30

40

50

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、ジアセトキシスルペノール(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を挙げることができ(これらに限定されるものではない)、これらは、例えば以下の真菌病: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. fujikoroi*)、フザリウム・ムサルム(*F. musarum*)、フザリウム・オキシスポルム(*F. oxy sporum*)、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. semitec tum*)、フザリウム・ソラニ(*F. solani*)、フザリウム・スプロトリコイデス(*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、さらにはアスペルギルス(*Aspergillus*)種、ペニシリウム(*Penicillium*)種、クラビセプス・ブルプレア(*Claviceps purpurea*)、スタキボトリス(*Stachybotrys*)種などを挙げができるが、これらに限定されるものではない。

【0199】

本発明による活性化合物組み合わせの良好な殺菌活性は、下記の実施例から明らかである。個々の活性化合物が示す殺菌活性は弱いが、当該組み合わせは、活性の単純な加算を超える活性を有する。

【0200】

活性化合物組み合わせの殺菌活性が、個別に施用した場合の活性化合物の活性の合計を超える場合には、殺菌剤の相乗効果は常に存在する。

【0201】

2種類の活性化合物の所定の組み合わせについての予想される活性は、下記のように計算することができる(Colby, S. R., Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations, Weeds 1967, 15, 20-22参照)。

【0202】

Xは、活性化合物Aを施用量m ppm(またはg/ha)で施用した場合の効力あり

Yは、活性化合物Bを施用量n ppm(またはg/ha)で施用した場合の効力あり

Eは、活性化合物AおよびBをそれぞれmおよびn ppm(またはg/ha)で施用した場合の効力あり、

【0203】

【数1】

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

10

20

30

30

40

50

である。

【0204】

%で表される効力度を示す。0%は対照の効力に相当する効力を意味し、100%の効力は、病害が全く観察されないことを意味する。

【0205】

実際の殺菌活性が計算値を超える場合、組み合わせの活性は超相加的であり、すなわち相乗効果が存在する。この場合、実際に観察された効力は、上記式から計算される予想効力についての値(E)より大きいものでなければならない。

【0206】

相乗効果を示す別 の方法は、Tammesの方法である(Isoboles, a graphic representation of synergism in pesticides, Neth. J. Plant Path., 1964, 70, 73-80 参照)。

【0207】

下記の実施例によって、本発明を説明する。しかしながら、本発明はこれら実施例に限定されるものではない。

【実施例】

【0208】

2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - [4 - { 5 - [2 , 6 - ジフルオロ - 4 - (プロブ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン (I - 4)

4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチル

4 - { 4 - [(Z / E) - (ヒドロキシイミノ) メチル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチル (1.75 g) および 3 , 5 - ジフルオロ - 4 - ビニルフェノール (1.05 g) の酢酸エチル (45 mL) 中溶液に室温で、重炭酸カリウム (2.81 g) および N - クロロコハク酸イミド (0.90 g) を加え、次に水 1 滴を加えた。反応混合物を 60 度で 4 時間攪拌し、次に酢酸エチルおよび水と混合し、酢酸エチルで抽出した。有機抽出液を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィーによって精製した。これによって、4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチル (0.62 g) を得た。

【0209】

¹ H NMR (DMSO - d₆ , 400 MHz) : _{ppm} : 1.41 (s , 9 H) , 1.48 - 1.62 (m , 2 H) , 1.98 - 2.08 (m , 2 H) , 2.81 - 2.96 (m , 2 H) , 3.45 (dd , 1 H) , 3.80 (dd , 1 H) , 3.96 - 4.06 (m , 2 H) , 5.87 (dd , 1 H) , 6.50 (m , 2 H) , 7.98 (s , 1 H) , 10.50 (s , 1 H) 。

【0210】

log P (HCOOH) : 3 , 24 。

【0211】

MS (ESI) : 366 ([M - C (CH₃)₃ OCO + H]⁺) 。

【0212】

4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジニウムクロライド

4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル) - 4 , 5 - ジヒド

10

20

30

40

40

50

口 - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - カルボン酸 *tert* - ブチル (620 mg) のジクロロメタン (4 mL) 中溶液に 0 で 4 M 塩化水素 / 1 , 4 - ジオキサン溶液 (8 . 5 mL) を滴下した。反応混合物を 0 で攪拌し、徐々に昇温させて室温とした。室温で 3 時間攪拌後、溶媒および過剰の塩化水素を除去した。これによって、4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジニウムクロライド (492 mg) を得た。

【 0213 】

¹ H NMR (DMSO - d₆ 、 400 MHz) : _{ppm} : 1 . 41 (s , 9 H) 、 1 . 48 - 1 . 62 (m , 2 H) 、 1 . 98 - 2 . 08 (m , 2 H) 、 2 . 81 - 2 . 96 (m , 2 H) 、 3 . 45 (dd , 1 H) 、 3 . 80 (dd , 1 H) 、 3 . 96 - 4 . 06 (m , 2 H) 、 5 . 87 (dd , 1 H) 、 6 . 50 (m , 2 H) 、 7 . 98 (s , 1 H) 、 10 . 50 (s , 1 H) 。

10

【 0214 】

log P (HCOOH) : 0 . 98 。

【 0215 】

MS (ESI) : 366 ([M - Cl + H]⁺) 。

【 0216 】

2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - (4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) エタノン

20

溶液 A : [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] 酢酸 (305 mg) のジクロロメタン (10 mL) 中溶液に、室温で、N , N - デミチルホルムアミド 1 滴およびオキサリルクロライド (0 . 320 mL) を滴下した。室温で 2 時間攪拌後、溶媒を除去し、残留物をジクロロメタン (5 mL) に再度解かした (溶液 A) 。

【 0217 】

4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジニウムクロライド (492 mg) のジクロロメタン (14 mL) 中溶液に室温でトリエチルアミン (1 . 7 mL) を加えた。15 分後、溶液 A を滴下した。室温で終夜攪拌後、反応混合物を水と混合し、酢酸エチルで抽出した。有機抽出液を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物をクロマトグラフィーによって精製した。これによって、2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - (4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) エタノン (360 mg) を得た。

30

【 0218 】

¹ H NMR (DMSO - d₆ 、 400 MHz) : _{ppm} : 1 . 51 - 1 . 61 (m , 1 H) 、 1 . 77 - 1 . 85 (m , 1 H) 、 2 . 06 - 2 . 17 (m , 2 H) 、 2 . 79 - 2 . 87 (m , 1 H) 、 3 . 23 - 3 . 31 (m , 1 H) 、 3 . 46 (dd , 1 H) 、 3 . 81 (dd , 1 H) 、 3 . 93 - 4 . 00 (m , 1 H) 、 4 . 31 - 4 . 39 (m , 1 H) 、 5 . 32 - 5 . 48 (m , 2 H) 、 5 . 88 (dd , 1 H) 、 6 . 49 (m , 2 H) 、 6 . 91 (s , 1 H) 、 7 . 04 (t , 1 H) 、 7 . 18 (t , 1 H) 、 8 . 01 (s , 1 H) 、 10 . 72 (s , 1 H) 。

40

【 0219 】

log P (HCOOH) : 2 . 58 。

【 0220 】

MS (ESI) : 574 ([M + H]⁺) 。

【 0221 】

50

2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - [4 - (4 - { 5 - [2 , 6 - ジフルオロ - 4 - (プロブ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン

2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - (4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) エタノン (384 mg) および炭酸カリウム (138 mg) の N , N - ジメチルホルムアミド (18 mL) 中溶液に、室温でヨウ化カリウム (61 mg) および 3 - プロモプロブ - 1 - イン (127 mg) を加える。反応混合物を 80 で 9 時間攪拌する。次に、混合物を希塩酸と混合し、酢酸エチルで抽出する。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、濃縮する。カラムクロマトグラフィーによる精製によって、2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - [4 - (4 - { 5 - [2 , 6 - ジフルオロ - 4 - (プロブ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン (60 mg) を得る。

【 0222 】

¹ H NMR (DMSO - d₆ , 400 MHz) : _{ppm} : 1.51 - 1.65 (m , 1 H) , 1.74 - 1.88 (m , 1 H) , 2.05 - 2.19 (m , 2 H) , 2.80 - 2.91 (m , 1 H) , 3.50 (dd , 1 H) , 3.65 (t , 1 H) , 3.85 (dd , 1 H) , 3.93 - 4.03 (m , 1 H) , 4.31 - 4.41 (m , 1 H) , 4.88 (d , 2 H) , 5.31 - 5.48 (m , 2 H) , 5.92 (dd , 1 H) , 6.85 (m , 2 H) , 6.90 (s , 1 H) , 7.02 (t , 1 H) , 7.18 (t , 1 H) , 8.02 (s , 1 H) 。

【 0223 】

10 g P (HCOOH) : 3.30 。

【 0224 】

MS (ESI) : 612 ([M + H]⁺) 。

【 0225 】

2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - [4 - (4 - { 5 - [2 , 6 - ジフルオロ - 3 - (プロブ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン (I - 7)

4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロ - 3 - ヒドロキシフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチル

4 - { 4 - [(ヒドロキシイミノ) メチル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチル (1.278 g) の酢酸エチル (80 mL) 中溶液に室温で、N - クロロコハク酸イミド (658 mg) を加えた。60 で 30 分間攪拌後、室温で反応混合物に 2 , 4 - ジフルオロ - 3 - ビニルフェノール (705 mg) 、炭酸水素カリウム (822 mg) および次に水 1 滴を加えた。室温で終夜攪拌後、反応混合物を酢酸エチルおよび水と混合し、酢酸エチルで抽出した。有機抽出液を硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に濃縮した。残留物を、クロマトグラフィーによって精製した。これによって、4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロ - 3 - ヒドロキシフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチル (658 mg) を得た。

【 0226 】

¹ H NMR (DMSO - d₆ , 400 MHz) : _{ppm} : 9.92 (s , 1 H) , 8.01 (s , 1 H) , 7.04 - 6.90 (m , 2 H) , 5.96 (dd , 1 H) , 4.01 (bd , 2 H) , 3.94 - 3.84 (m , 1 H) , 3.50 (dd , 1 H) , 2

10

20

30

40

50

. 1 0 - 2 . 0 0 (m、 2 H)、 1 . 6 3 - 1 . 5 0 (m、 2 H)、 1 . 4 2 (s、 9 H)。

【 0 2 2 7 】

2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - (4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロ - 3 - ヒドロキシフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) エタノン

4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロ - 3 - ヒドロキシフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - カルボン酸 t e r t - ブチル (3 . 9 2 g) のジクロロメタン (1 5 mL) 中溶液に 0 で、 4 M 塩化水素 (1 0 当量) / 1 , 4 - ジオキサンを滴下した。反応混合物を 0 で攪拌し、徐々に昇温させて室温とした。5時間攪拌後、溶媒および過剰の塩化水素を除去した。これによって、4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロ - 3 - ヒドロキシフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジニウムクロライドを得た (化合物 A)。

【 0 2 2 8 】

[3 , 5 - ビス - (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] 酢酸 (2 g) のジクロロメタン (4 0 mL) 中溶液に 0 で、 オキサリルクロライド (3 . 2 7 3 g) および N , N - ジメチルホルムアミド 1 滴を加える。反応混合物を室温で 2 時間攪拌する。溶媒および過剰の試薬を減圧下に除去する。固体残留物を再度、ジクロロメタン (1 5 mL) に溶かし、0 で 4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロ - 3 - ヒドロキシフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジニウムクロライド (化合物 A) およびトリエチルアミン (5 . 0 当量) のジクロロメタン (1 0 0 mL) 中溶液に滴下する。反応混合物を室温で終夜攪拌する。次に、それを濃炭酸水素ナトリウム溶液と混合し、水相を除去し、酢酸エチルで抽出する。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、濃縮する。カラムクロマトグラフィーによる精製によって、2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - (4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロ - 3 - ヒドロキシフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) エタノン (1 . 8 1 8 g) を得る。

【 0 2 2 9 】

¹ H N M R (D M S O - d ₆ 、 4 0 0 M H z) : _{ppm} : 9 . 9 1 (s、 1 H) 、 8 . 0 3 (s、 1 H) 、 7 . 1 8 (t、 1 H) 、 7 . 0 3 (t、 1 H) 、 7 . 0 2 - 6 . 8 8 (m、 3 H) 、 5 . 9 6 (d d、 1 H) 、 5 . 4 0 (q、 2 H) 、 4 . 3 6 (b d、 1 H) 、 4 . 0 2 - 3 . 8 4 (m、 2 H) 、 3 . 5 5 (d d、 1 H) 、 3 . 4 5 - 3 . 2 2 (m、 2 H) 、 2 . 8 4 (t、 1 H) 、 2 . 1 1 (t、 2 H) 、 1 . 8 8 - 1 . 7 5 (m、 1 H) 、 1 . 6 5 - 1 . 5 0 (m、 1 H) 。

【 0 2 3 0 】

1 0 g P (H C O O H) : 2 . 6 1 。

【 0 2 3 1 】

2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - [4 - (4 - { 5 - [2 , 6 - ジフルオロ - 3 - (プロブ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン

2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - (4 - { 4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロ - 3 - ヒドロキシフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル) エタノン (1 . 8 2 g) および炭酸カリウム (6 5 7 m g) の N , N - ジメチルホルムアミド (1 5 mL) 中溶液に室温で、ヨウ化カリウム (2 8 9 m g) および 3 - プロモプロブ - 1 - イン (7 5 5 m g) (8 0 重量 % トルエン中溶液) を加える。反応混合

10

20

30

40

50

物を 80 ℃ で 4 時間攪拌する。次に、混合物を飽和塩化アンモニウム水溶液と混合し、酢酸エチルで抽出する。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで脱水し、濃縮する。カラムクロマトグラフィーによる精製によって、2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2,6-ジフルオロ-3-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン、(1.68 g) が得られる。

【0232】

¹H NMR (DMSO-d₆、400 MHz) : _{ppm} : 8.03 (s, 1H)、7.46-7.26 (m, 1H)、7.18 (t, 1H)、7.20-7.08 (m, 1H)、7.03 (t, 1H)、6.91 (s, 1H)、5.99 (dd, 1H)、5.40 (q, 2H)、4.89 (d, 2H)、4.35 (bs, 1H)、4.06-3.85 (m, 2H)、3.64 (t, 1H)、3.54 (dd, 1H)、3.46-3.21 (m, 2H)、2.84 (t, 1H)、2.12 (t, 2H)、1.89-1.75 (m, 1H)、1.65-1.50 (m, 1H)。 10

【0233】

log P (HCOOH) : 3.17。

【0234】

下記の実施例を、これに従って合成することができる。

【0235】

(I-1) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン log p : 3,24^[b]; 3,34^[c]

(I-2) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[4-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン log p : 3,08^[b]; 3,14^[c]

(I-3) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[3-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン log p : 3,16^[b]; 3,24^[c] 30

(I-5) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン log p : 3,15^[b]; 3,18^[c]

(I-6) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン log p : 3,51^[a]; 3,4^[b] 40

(I-8) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[5-フルオロ-2-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン log p : 3,37^[b]; 3,44^[c]

(I-9) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[4-メトキシ-2-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾー-

20

30

40

50

ル - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン 10g p : 3, 25 [^b] ; 3, 2 [^c]

(I - 10) 2 - [3, 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - [4 - (4 - { 5 - [3 - フルオロ - 2 - (プロプ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル) ピペリジン - 1 - イル] エタノン 10g p : 3, 37 [^b] ; 3, 48 [^c] 。

【 0236 】

10 10g P 値の測定は、 EEC 指針 79/831 付属書 V.A.8 に従って、下記の方法を用いる逆相カラムでの HPLC (高速液体クロマトグラフィー) によって行った。

【 0237 】

[^a] 測定は、溶離液として 0.1% リン酸およびアセトニトリルを用いて pH 2.3 で行った。

【 0238 】

[^b] LC - MS の測定は、 0.1% ギ酸 / 水で pH 2.7 とし、溶離液としてアセトニトリル (0.1% ギ酸を含有) を 10% アセトニトリルから 95% アセトニトリルの勾配で用いて行った。

【 0239 】

[^c] LC - MS による測定は、 10% アセトニトリルから 95% アセトニトリルの直線勾配で 溶離液として 0.001M 炭酸水素アンモニウム水溶液を用いて、 pH 20 7.8 で行った。

【 0240 】

較正は、 10g P 値が既知である (連続するアルカノン間の線形補間により保持時間を用いる 10g P 値の測定) 分岐していないアルカン 2 - オン類 (炭素原子数 3 から 16) を用いて行った。 _{m a x} 値は、 200nm から 400nm の UV スペクトラムおよびクロマトグラフィーシグナルのピーク値を用いて求めた。

【 0241 】

NMR ピークリスト

選択された実施例の ¹H - NMR データを、 ¹H - NMR - ピークリストの形態で記載する。各シグナルピークに対して、区切りとして空白を設けて ppm での 値とシグナル強度を挙げる。 値 - シグナル強度のペア間には、区切りとしてセミコロンを設けている。

【 0242 】

従って、一つの実施例のピークリストは、次の形態となる。

【 0243 】

1 強度 ₁ ; 2 強度 ₂ ; ; _i 強度 _i ; ; _n 強度 _n

NMR スペクトラムを測定した溶媒は、実施例番号の後、そして NMR - ピークリストの前に、かぎ括弧内に記載している。

【 0244 】

10

20

30

40

【表1】

実施例番号 I-1 [DMSO-D ₆] 8.0055 16.00;7.3472 1.39;7.3429 1.89;7.3238 8.76;7.3048 10.15;7.1707 5.98;7.1567 3.82;7.1514 4.37;7.1317 3.60;7.0375 2.99;7.0210 8.97;7.0035 4.27;6.9848 2.03;6.8977 5.49;6.8852 3.32;5.8869 2.12;5.8691 2.50;5.8594 2.52;5.8413 2.24;5.4480 1.14;5.4048 4.22;5.3631 4.23;5.3208 1.12;4.8765 12.42;4.8706 12.41;4.3586 1.31;4.3257 1.38;3.9762 1.35;3.9425 1.47;3.8964 2.48;3.8686 2.86;3.8534 3.19;3.8257 2.87;3.7713 0.39;3.7658 0.37;3.7408 0.35;3.7236 0.39;3.6946 0.41;3.6901 0.44;3.6139 0.50;3.6009 0.57;3.5655 3.69;3.5596 7.65;3.5537 3.68;3.5269 0.74;3.5095 0.83;3.4837 1.00;3.4673 1.14;3.4479 1.33;3.4029 3.19;3.3743 6.16;3.3121 5148.85;3.2885 58.37;3.2715 8.09;3.2534 5.49;3.2284 4.06;3.2105 3.16;3.1748 0.37;2.8624 0.95;2.8325 1.66;2.8060 1.01;2.6952 0.56;2.6787 1.83;2.6741 3.46;2.6695 4.52;2.6649 3.37;2.6603 1.74;2.6277 0.54;2.5395 5.91;2.5227 18.48;2.5094 256.55;2.5050 482.43;2.5005 633.82;2.4960 435.65;2.4916 205.46;2.3364 1.51;2.3317 3.16;2.3272 4.18;2.3225 3.02;2.3179 1.43;2.1278 1.15;2.0948 2.38;2.0688 10.42;1.9078 0.32;1.8353 0.55;1.8047 1.09;1.7818 0.95;1.7727 0.92;1.7518 0.40;1.7445 0.38;1.5999 0.49;1.5800 1.01;1.5699 1.05;1.5486 1.04;1.5398 1.01;1.5191 0.45;1.2356 0.80;0.8904 0.61;0.0080 2.38;-0.0002 56.69;-0.0084 2.00	10
実施例番号 I-2 [DMSO-D ₆] 9.9022 0.44;8.7772 0.50;8.6463 0.42;8.0130 16.00;7.7728 0.64;7.7581 0.33;7.7407 0.50;7.5929 0.52;7.3484 9.21;7.3313 4.39;7.3267 10.28;7.3088 3.30;7.2042 0.38;7.1754 7.08;7.1595 3.59;7.0421 3.74;7.0234 8.65;7.0126 11.26;7.0076 4.29;6.9955 3.95;6.9907 9.69;6.9573 0.62;6.9001 7.60;6.8876 4.10;5.7464 13.29;5.6954 2.45;5.6739 3.26;5.6688 2.96;5.6472 2.43;5.4524 1.52;5.4104 5.36;5.3688 5.44;5.3262 1.43;4.8008 14.95;4.7949 14.86;4.7407 0.94;4.3647 1.74;4.3317 1.80;4.0571 0.80;4.0392 2.27;4.0214 2.32;4.0037 1.21;3.9850 1.69;3.9517 1.80;3.8530 2.59;3.8260 2.95;3.8100 3.38;3.7831 2.88;3.5499 3.63;3.5440 7.26;3.5382 3.57;3.4766 0.33;3.4424 0.49;3.4165 1.72;3.4070 1.58;3.3895 5.58;3.3785 2.68;3.3685 4.75;3.3595 2.82;3.3469 4.70;3.3252 7.94;3.3047 416.16;3.2810 7.73;3.2426 1.41;3.0372 0.33;2.8752 1.34;2.8491 2.27;2.8170 1.23;2.6737 0.74;2.6693 1.21;2.6648 0.70;2.5390 1.68;2.5087 48.88;2.5045 86.78;2.5000 110.03;2.4957 76.72;2.3313 0.55;2.3268 0.72;2.3222 0.49;2.1375 1.59;2.1049 3.18;2.0691 2.49;1.9868 9.24;1.9080 0.66;1.8444 0.72;1.8229 1.38;1.8154 1.43;1.7920 1.34;1.7626 0.56;1.6213 0.60;1.6144 0.71;1.5938 1.36;1.5841 1.46;1.5630 1.36;1.5542 1.28;1.5340 0.60;1.2366 0.62;1.1927 2.59;1.1749 5.02;1.1571 2.49;-0.0002 5.18	30
実施例番号 I-3 [DMSO-D ₆] 8.0183 1.38;7.3327 0.53;7.1725 0.58;7.0218 0.70;7.0082 0.35;6.9906 0.80;6.8999 0.59;6.8859 0.33;5.7441 7.03;5.4070 0.43;5.3656 0.46;4.8067 1.20;4.8008 1.20;4.3506 0.38;4.3380 0.69;4.3252 0.44;4.0903 0.34;4.0772 0.36;4.0572 1.22;4.0394 3.66;4.0216 3.70;4.0038 1.27;3.5397 0.39;3.5338 0.72;3.5281 0.38;3.4750	40

0.33;3.4622 0.37;3.4575 0.64;3.4448 0.70;3.4401 0.74;3.4273 0.79;3.4226 0.61;3.4098 0.68;3.3964 1.04;3.3757 1.59;3.3299 662.84;3.3068 6.66;3.1773 1.22;3.1642 1.18;2.6708 0.41;2.5408 0.57;2.5240 1.51;2.5106 21.47;2.5063 40.33;2.5018 52.87;2.4974 36.58;2.4930 17.42;2.4636 0.33;2.4454 0.49;2.4280 0.46;2.3285 0.36;2.0685 0.90;1.9869 16.00;1.1930 4.40;1.1752 8.70;1.1574 4.29;1.0748 0.93;1.0572 1.77;1.0398 0.88;0.9521 1.12;0.9343 2.20;0.9165 1.07;-0.0002 0.67	
実施例番号 I-5 [DMSO-D ₆] 7.9681 16.00;7.4330 1.50;7.4160 1.98;7.4119 3.10;7.3952 3.13;7.3910 1.89;7.3739 1.51;7.3085 2.56;7.1750 5.80;7.1585 2.74;7.0418 2.83;7.0226 6.92;7.0121 4.36;6.9908 3.84;6.9093 3.01;6.9008 5.87;6.8865 5.33;6.8644 1.87;6.0740 1.94;6.0516 2.36;6.0436 2.19;6.0213 1.96;5.4545 1.14;5.4110 4.19;5.3690 4.16;5.3271 1.09;4.8870 0.53;4.8816 0.59;4.8472 6.66;4.8417 10.99;4.8361 6.08;4.8020 0.48;4.7962 0.58;4.3673 1.31;4.3338 1.42;3.9904 1.39;3.9536 1.47;3.8311 0.43;3.8095 1.58;3.7769 1.77;3.7681 2.13;3.7375 1.93;3.5278 3.35;3.5207 4.59;3.5148 8.43;3.5088 5.00;3.4848 3.01;3.4631 3.39;3.3942 7.50;3.3307 5101.71;3.3077 39.28;3.2505 2.33;3.2140 0.93;3.1513 0.33;2.8803 0.83;2.8505 1.57;2.8219 0.84;2.6753 1.19;2.6708 1.61;2.6661 1.17;2.6613 0.59;2.5407 2.04;2.5107 94.07;2.5063 176.46;2.5017 231.85;2.4973 160.85;2.4929 77.91;2.3331 1.24;2.3283 1.57;2.1548 1.15;2.1171 2.28;2.0796 1.44;2.0684 11.58;1.8497 0.53;1.8211 1.07;1.7995 1.06;1.6243 0.49;1.5944 1.06;1.5722 1.05;1.5414 0.42;1.2375 0.37;-0.0002 12.57	10
実施例番号 I-6 [DMSO-D ₆] 7.9699 10.61;7.4071 2.41;7.3934 4.66;7.3796 3.07;7.2752 1.62;7.1866 3.78;7.1592 4.04;7.1538 4.69;7.1452 3.55;7.1404 4.18;7.1317 1.81;7.0981 1.82;7.0412 4.24;6.9510 1.99;6.9167 4.54;6.2241 1.96;6.2077 2.40;6.2036 2.22;6.1871 1.98;5.7656 16.00;5.4603 1.61;5.4319 3.45;5.3819 3.39;5.3536 1.59;4.8286 0.82;4.8247 0.79;4.8020 3.81;4.7981 3.85;4.7899 3.79;4.7861 3.61;4.7633 0.81;4.7594 0.80;4.3670 1.08;4.3451 1.11;4.0452 0.51;4.0334 1.53;4.0215 1.55;4.0097 0.53;3.9852 1.04;3.9628 1.11;3.7541 1.50;3.7334 1.91;3.7262 2.29;3.7056 1.88;3.5693 2.07;3.5530 2.10;3.5414 1.63;3.5251 1.59;3.4631 2.42;3.4592 4.73;3.4554 2.22;3.4198 0.46;3.4137 0.81;3.4074 0.57;3.4008 0.99;3.3946 1.65;3.3883 1.06;3.3754 1.57;3.3523 274.08;3.3299 1.08;3.2952 0.77;3.2912 0.87;3.2716 1.51;3.2523 0.85;3.2486 0.70;2.8618 0.76;2.8431 1.38;2.8236 0.77;2.6180 0.64;2.6151 0.84;2.6121 0.61;2.5428 0.39;2.5241 2.50;2.5211 3.45;2.5062 103.50;2.5033 133.72;2.5004 96.81;2.3904 0.69;2.3875 0.88;2.3846 0.64;2.1497 0.99;2.1296 1.16;2.1078 1.06;2.0877 1.09;2.0787 0.92;1.9906 6.59;1.8398 0.37;1.8207 0.88;1.8017 0.83;1.6093 0.33;1.6029 0.39;1.5892 0.87;1.5828 0.90;1.5688 0.88;1.5627 0.83;1.5490 0.35;1.1858 1.79;1.1740 3.53;1.1622 1.75;0.0051 0.44;-0.0002 8.35	30
実施例番号 I-8 [DMSO-D ₆] 8.2694 0.37;8.0297 16.00;7.9423 0.34;7.3091 2.84;7.1813 6.20;7.1772 11.27;7.1662 10.80;7.1624 8.45;7.0958 2.91;7.0732 3.19;7.0426 3.23;7.0294	40

7.49;6.9051 6.34;6.8935 3.90;5.8645 2.29;5.8471 2.58;5.8369 2.65;5.8193 2.37;5.4555 1.50;5.4132 5.05;5.3703 4.97;5.3273 1.58;4.8808 13.15;4.8749 13.81;4.3601 1.47;4.3275 1.57;3.9771 1.37;3.9407 1.52;3.9294 2.96;3.9015 2.87;3.8861 3.23;3.8584 2.64;3.6039 2.94;3.5981 6.75;3.5921 3.20;3.4144 0.70;3.4048 1.16;3.3952 0.96;3.3853 1.40;3.3759 2.57;3.3666 1.96;3.3337 316.84;3.3303 523.70;3.3286 460.30;3.3252 593.19;3.2919 6.64;3.2742 4.45;3.2582 2.69;3.2487 4.11;3.2310 4.04;3.1993 0.56;3.1490 0.35;3.1246 0.33;2.8581 1.12;2.8268 1.93;2.7999 1.08;2.6796 0.53;2.6753 1.26;2.6707 1.76;2.6660 1.35;2.5409 1.12;2.5240 3.16;2.5106 90.30;2.5061 191.47;2.5015 264.57;2.4969 200.78;2.4925 103.79;2.3329 1.42;2.3283 1.93;2.3238 1.50;2.1244 1.34;2.0912 2.76;2.0736 13.65;2.0591 1.66;1.8417 0.52;1.8317 0.61;1.8123 1.21;1.8025 1.29;1.7812 1.18;1.7728 1.17;1.7501 0.51;1.6054 0.50;1.5955 0.62;1.5739 1.21;1.5645 1.36;1.5442 1.21;1.5343 1.19;1.5136 0.52;1.5038 0.44;1.2353 0.90;0.1460 0.45;0.0081 3.18;-0.0002 106.36;-0.0084 5.20;-0.1499 0.45

実施例番号 I-9 [DMSO-D ₆] 9.7648 0.40;7.9977 5.78;7.9717 0.36;7.3105 1.24;7.2239 2.35;7.2028 2.50;7.1771 2.83;7.1657 1.46;7.0442 1.45;7.0299 3.16;6.9057 3.58;6.8943 1.72;6.7107 2.56;6.7047 2.70;6.5880 1.61;6.5824 1.35;6.5667 1.43;6.5612 1.25;5.8121 0.94;5.7933 1.12;5.7844 1.16;5.7656 1.11;5.4587 0.72;5.4144 2.49;5.3719 2.50;5.3292 0.88;4.8596 4.64;4.8539 4.69;4.3610 0.80;4.3280 0.83;4.0557 0.50;4.0382 1.43;4.0203 1.50;4.0018 0.54;3.9815 0.81;3.9460 0.83;3.8409 0.48;3.8294 0.40;3.8150 0.97;3.7878 1.26;3.7721 1.29;3.7534 16.00;3.6856 1.58;3.5763 1.35;3.5708 2.96;3.4146 0.49;3.4061 0.72;3.3766 1.59;3.3657 1.55;3.3367 262.16;3.3302 692.11;3.2913 1.36;3.2802 1.61;3.2608 2.29;3.2369 1.33;3.2187 1.11;2.8610 0.54;2.8343 1.02;2.8008 0.58;2.7985 0.47;2.6712 1.05;2.5415 0.45;2.5018 180.11;2.3285 1.07;2.1308 0.74;2.0978 1.42;2.0732 1.60;2.0602 0.78;1.9885 5.87;1.8153 0.67;1.8089 0.69;1.7838 0.61;1.7769 0.59;1.5781 0.62;1.5699 0.66;1.5476 0.66;1.5404 0.57;1.3973 0.52;1.2589 0.38;1.2367 0.91;1.1923 1.51;1.1746 2.97;1.1568 1.53;0.8684 0.36;0.8490 0.45;0.8303 0.33;-0.0002 10.43

実施例番号 I-10 [DMSO-D ₆] 8.8000 0.35;8.0314 16.00;8.0258 0.56;7.3002 1.37;7.2954 1.51;7.2887 1.57;7.2839 2.00;7.2810 1.63;7.2724 3.50;7.2647 1.91;7.2587 0.45;7.1955 0.88;7.1824 8.23;7.1755 8.85;7.1706 6.38;7.1683 4.98;7.1624 1.02;7.1294 2.47;7.0939 2.49;7.0390 6.09;6.9487 2.81;6.9145 5.99;5.9825 2.63;5.9702 2.96;5.9639 2.84;5.9516 2.64;5.4543 2.00;5.4259 4.37;5.3764 4.54;5.3480 2.07;4.8469 12.91;4.8429 12.80;4.3581 1.42;4.3361 1.43;4.0454 0.68;4.0335 1.99;4.0217 2.00;4.0099 0.69;3.9754 1.36;3.9469 3.25;3.9281 2.81;3.9181 2.98;3.8995 2.46;3.6563 3.62;3.6524 7.40;3.6484 3.44;3.4078 1.31;3.4019 1.98;3.3887 2.94;3.3825 4.59;3.3761 5.15;3.3509 1174.43;3.3311 6.48;3.3273 18.77;3.3192 3.56;3.3068 0.53;3.2844 1.13;3.2807 1.28;3.2611 2.01;3.2418 1.16;3.1708 0.76;3.1622 0.74;2.8500 1.05;2.8299 1.79;2.8120 1.06;2.6180 1.96;2.6150 2.59;2.6120 1.91;2.6091 0.99;2.5427 2.69;2.5242 8.11;2.5211 10.12;2.5179 11.89;2.5091

139.51;2.5062	280.13;2.5032	371.18;2.5002	269.11;2.4973	124.42;2.3933	0.95;2.3904
1.85;2.3874	2.43;2.3844	1.74;2.1262	1.29;2.1054	1.53;2.0868	1.43;2.0782
5.17;2.0671	1.39;1.9905	8.79;1.8320	0.51;1.8253	0.60;1.8114	1.17;1.8053
1.27;1.7905	1.21;1.7847	1.11;1.7707	0.52;1.7643	0.41;1.5910	0.47;1.5847
0.57;1.5708	1.17;1.5644	1.23;1.5504	1.20;1.5442	1.11;1.5301	0.49;1.5239
0.41;1.3969	3.62;1.2337	1.97;1.1860	2.41;1.1741	4.71;1.1623	2.36;0.8535
0.32;0.0966	0.33;0.0052	3.55;-0.0002	79.84;-0.0057	2.64	

10

N M R ピークリスト法、詳細

ピークリストの形でのN M R データの表示についての詳細な説明は、刊行物「特許出願内のN M R ピークリストデータの引用 (Citation of N M R Peak list Data within Patent Applications)」(http://www.rdelectronic.co.uk/rd/free/RD564025.pdf)にある。

【0245】

生物実施例

疫病菌試験（トマト）/ 予防的

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

好適な活性化合物製剤を製造するため、活性化合物1重量部を指定量の溶媒および乳化剤と混和し、濃厚液を水で希釈して所望の濃度とする。

20

【0246】

予防活性について調べるため、若い植物に活性化合物製剤を指定施用量で噴霧する。噴霧コーティングを乾燥させた後、植物にフィトフトラ・インフェスタンス (Phytophthora infestans) の水系胞子懸濁液を接種する。次に、植物を、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ネットに入れる。

30

【0247】

接種から3日後に試験を評価する。0%は未処理対照の効力に相当する効力を意味し、100%の効力は疾患が認められないことを意味する。

【0248】

下記の表は、本発明による活性化合物組み合わせの観察された活性が計算された活性より高いこと、すなわち相乗効果が存在することを明瞭に示している。

【0249】

表1

疫病菌試験（トマト）/ 保護的

【0250】

【表2】

活性化合物	活性化合物の施用量(ppm 有効成分)	効力(%)	
		実測値*	計算値**
(I-1) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロピ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	0.01	0	10
(I-5) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロピ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	0.01	62	20
3.1 アメトクトラジン	10	0	
9.5 マンジプロパミド	0.2	0	
14.4 フルアジナム	10	0	
15.9 シモキサニル	10	0	
15.24 ホセタール(fosetal)-Al	10	0	30
15.41 リン酸	10	0	
(I-5)+3.1 1:1000	0.01+10	94	62
(I-1)+9.5 1:20	0.01+0.2	75	0
(I-5)+9.5 1:20	0.01+0.2	95	62
(I-5)+14.4 1:1000	0.01+10	100	62
(I-5)+15.9 1:1000	0.01+10	83	40
(I-1)+15.24 1:1000	0.01+10	80	0
(I-5)+15.41 1:1000	0.01+10	84	62

*実測値=実測活性

**計算値=コルビーの式を用いて計算した活性

表2
疫病菌試験(トマト)/保護的

【表3】

活性化合物	活性化合物の施用量(ppm 有効成分)	効力(%)	
		実測値*	計算値**
(I-1) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロブ-2-イソ-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	0.01 0.0025	42 52	
(I-5) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロブ-2-イソ-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	0.005	43	
3.10 フェンアミドン	0.25	6	
5.8 オキシ塩化銅	10 5	10 12	
5.16 ホルペット	10 5	3 3	
5.25 メチラム	10 5	24 12	
10.10 プロパモカルブ-HCl	5	7	
15.60 2,6-ジメチル-1H,5H-[1,4]ジチイノ[2,3-c:5,6-c']ジピロール-1,3,5,7(2H,6H)-テトロン	5	49	
(I-1)+3.10 1:100	0.0025+0.25	74	55
(I-1)+5.8 1:1000	0.01+10	77	48
(I-5)+5.8 1:1000	0.005+5	63	50
(I-1)+5.16 1:1000	0.01+10	56	44
(I-5)+5.16 1:1000	0.005+5	58	45
(I-1)+5.25 1:1000	0.01+10	95	56
(I-5)+5.25 1:1000	0.005+5	60	50
(I-5)+10.10 1:1000	0.005+5	63	47
(I-5)+15.60 1:1000	0.005+5	85	71

*実測値=実測活性

**計算値=コルビーの式を用いて計算した活性

表3

疫病菌試験(トマト)/保護的

10

20

30

40

50

【0252】

【表4】

活性化合物	活性化合物の施用量(ppm 有効成分)	効力(%)	
		実測値*	計算値**
(I-1) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロピ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	0,01	29	
5.29 プロピネブ	10	24	
7.7 ピリメタニル	10	10	
(I-1)+5.29 1:1000	0.01+10	61	46
(I-1)+7.7 1:1000	0.01+10	50	36

*実測値=実測活性

**計算値=コルベーの式を用いて計算した活性

表4
疫病菌試験(トマト) / 保護的

【0253】

10

20

【表5】

活性化合物	活性化合物の施用量(ppm 有効成分)	効力(%)	
		実測値*	計算値**
(I-1) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	0.01	15	
(I-6) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	0.005	35	
3.3 アゾキシストロビン	1	0	
3.12 フルオキサストロビン	2	0	
	1	0	
3.17 ピラクロストロビン	2	0	
	1	0	
3.22 トリフロキシストロビン	2	0	
	1	0	
10.10 プロパモカルブ-HCl	10	18	
5.30 硫黄	10	0	
	5	0	
(I-6)+3.3 200:1	0.005+1	65	35
(I-1)+3.12 200:1	0.01+2	60	15
(I-6)+3.12 200:1	0.005+1	68	35
(I-1)+3.17 200:1	0.01+2	50	15
(I-6)+3.17 200:1	0.005+1	86	35
(I-1)+3.22 200:1	0.01+2	58	15
(I-6)+3.22 200:1	0.005+1	65	35
(I-1)+10.10 1:1000	0.01+10	75	30
(I-1)+5.30 1:1000	0.01+10	50	15
(I-6)+5.30 1:1000	0.005+5	55	35

*実測値=実測活性

**計算値=コルビーの式を用いて計算した活性

疫病菌試験(トマト) / 保護的
 【0254】
 【表6】

活性化合物	活性化合物の施用量(ppm 有効成分)	効力(%)	
		実測値*	計算値**
(I-1) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロピ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	0.0025	64	10
(I-6) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロピ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	0.0025	73	20
3.1 アメトクトラジン	2.5	52	
3.4 シアゾファミド	0.1	0	
3.9 ファモキサドン	2.5	30	
4.6 フルオピコリド	0.5	12	
(I-1)+3.1 1:1000	0.0025+2.5	91	30
(I-6)+3.4 1:40	0.0025+0.1	81	73
(I-1)+3.9 1:1000	0.0025+2.5	92	75
(I-1)+4.6 1:200	0.0025+0.5	79	68

*実測値=実測活性

**計算値=コルベーの式を用いて計算した活性

実施例

40

アルタナリア試験(トマト) / 予防的

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

好適な活性化合物製剤を製造するため、活性化合物 1 重量部を指定量の溶媒および乳化剤と混和し、濃厚液を水で希釈して所望の濃度とする。

【0255】

予防活性について調べるため、若い植物に活性化合物製剤を指定施用量で噴霧する。噴霧コーティングを乾燥させた後、植物にアルタナリア・ソラニ (A l t e r n a r i a s o l a n i) の水系胞子懸濁液を接種する。次に、植物を、約 20 および相対空気湿

50

度 100 % のインキュベーションキャビネットに入れる。

【 0 2 5 6 】

接種から 3 日後に試験を評価する。0 % は未処理対照の効力に相当する効力を意味し、100 % の効力は疾患が認められないことを意味する。

【 0 2 5 7 】

下記の表は、本発明による活性化合物組み合わせの観察された活性が計算された活性より高いこと、すなわち相乗効果が存在することを明瞭に示している。

【 0 2 5 8 】

表 6

アルタナリア試験 (トマト) / 予防的

10

【 0 2 5 9 】

【表7】

活性化合物	活性化合物の施用量(ppm 有効成分)	効力(%)	
		実測値*	計算値**
(I-1) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロピ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	100	0	
(I-5) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロピ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	50	15	
5.5 水酸化銅	20	16	
5.23 マンコゼブ	10	0	
5.29 プロピネブ	20 10	2 0	
7.7 ピリメタニル	20	4	
(I-1)+5.5 5:1	100+20	50	16
(I-1)+5.23 10:1	100+10	50	0
(I-1)+5.29 5:1	100+20	50	2
(I-5)+5.29 5:1	50+10	81	15
(I-1)+7.7 5:1	100+20	56	4

*実測値=実測活性

**計算値=コルベーの式を用いて計算した活性

表7
アルタナリア試験(トマト) / 予防的
【0260】

【表8】

活性化合物	活性化合物の施用量(ppm 有効成分)	効力(%)	
		実測値*	計算値**
(I-1) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロプ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	50	21	10
(I-5) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロプ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	50	29	20
5.8 オキシ塩化銅	25	7	
5.16 ホルペット	5	21	
5.25 メチラム	50	36	
15.60 2,6-ジメチル-1H,5H-[1,4]ジチイノ[2,3-c:5,6-c']ジピロール-1,3,5,7(2H,6H)-テトロン	25	29	30
(I-1)+5.8 2:1	50+25	64	27
(I-1)+5.16 10:1	50+5	64	38
(I-5)+5.16 10:1	50+5	80	44
(I-1)+5.25 1:1	50+50	71	49
(I-1)+15.60 2:1	50+25	86	44
(I-5)+15.60 2:1	50+25	79	50

*実測値=実測活性

**計算値=コルベーの式を用いて計算した活性

表8
 アルタナリア試験(トマト) / 予防的
 【0261】

【表9】

活性化合物	活性化合物の施用量(ppm 有効成分)	効力(%)	
		実測値*	計算値**
(I-1) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロピ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	50	30	
(I-6) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロピ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	50 25	35 30	
2.1 ビキサフェン	0.25	60	
2.8 フルキサピロキサド	0.125	63	
2.12 イソピラザム	0.25	60	
2.29 ベンゾビンジフルビル	0.25	40	
(I-1)+2.1 200:1	50+0.25	84	72
(I-6)+2.1 200:1	50+0.25	93	74
(I-6)+2.8 200:1	25+0.125	90	74
(I-1)+2.12 200:1	50+0.25	83	72
(I-1)+2.29 200:1	50+0.25	91	58
(I-6)+2.29 200:1	50+0.25	75	61

*実測値=実測活性

**計算値=コルビーの式を用いて計算した活性

表9
アルタナリア試験(トマト) / 予防的
【0262】

10

20

30

40

【表10】

活性化合物	活性化合物の施用量(ppm 有効成分)	効力(%)	
		実測値*	計算値**
(I-1) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロプ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	50	18	
(I-6) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロプ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	100 50	41 29	
3.3 アゾキシストロビン	0.25	9	
3.12 フルオキサストロビン	0.5	18	
3.17 ピラクロストロビン	0.25	18	
3.22 トリフロキシストロビン	0.25	18	
10.10 プロパモカルブ-HCl	400 200	18 0	
5.30 硫黄	200	18	
(I-1)+3.3 200:1	50+0.25	53	25
(I-6)+3.3 200:1	50+0.25	53	35
(I-6)+3.12 200:1	100+0.5	65	52
(I-1)+3.17 200:1	50+0.25	87	33
(I-6)+3.17 200:1	50+0.25	88	42
(I-1)+3.22 200:1	50+0.25	53	33
(I-6)+3.22 200:1	50+0.25	74	42
(I-1)+10.10 1:4	50+200	53	18
(I-6)+10.10 1:4	100+400	65	52
(I-1)+5.30 1:4	50+200	59	33
(I-6)+5.30 1:4	50+200	71	42

*実測値=実測活性

**計算値=コルビーの式を用いて計算した活性

実施例ベンチュリア試験(リンゴ) / 予防的

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

10

20

30

40

50

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

好適な活性化合物製剤を製造するため、活性化合物 1 重量部を指定量の溶媒および乳化剤と混和し、濃厚液を水で希釈して所望の濃度とする。

【0263】

予防活性について調べるため、若い植物に活性化合物製剤を指定施用量で噴霧する。噴霧コーティングを乾燥させた後、植物にリンゴさび病の原因菌（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、次に、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ネットに 1 日入れておく。

【0264】

次に、植物を約 21 および相対空気湿度約 90 % の温室に入れる。

【0265】

接種から 10 日後に試験を評価する。0 % は未処理対照の効力に相当する効力を意味し、100 % の効力は疾患が認められないことを意味する。

【0266】

表 10

ベンチュリア試験（リンゴ）／予防的

【0267】

【表 1 1】

活性化合物	活性化合物の施用量(ppm 有効成分)	効力(%)	
		実測値*	計算値**
(I-1) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロピ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	100 25	8 0	
(I-6) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロピ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	100 25	4 0	
2.1 ビキサフェン	0.5	26	
2.2 ボスカリド	12.5	66	
2.6 フルオピラム	4	33	
2.8 フルキサピロキサド	0.5	54	
2.12 イソピラザム	0.5	76	
2.27 N-[1-(2,4-ジクロロフェニル)-1-メトキシプロパン-2-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド	4	87	
(I-1)+2.1 200:1	100+0.5	79	32
(I-1)+2.2 2:1	25+12.5	84	66
(I-6)+2.2 2:1	25+12.5	97	66
(I-1)+2.6 25:1	100+4	85	38
(I-6)+2.6 25:1	100+4	85	36
(I-1)+2.8 200:1	100+0.5	89	58
(I-6)+2.8 200:1	100+0.5	98	56
(I-1)+2.12 200:1	100+0.5	99	78
(I-6)+2.12 200:1	100+0.5	89	77
(I-1)+2.27 25:1	100+4	99	88

*実測値=実測活性

**計算値=コルベーの式を用いて計算した活性

表 1 1
ベンチュリア試験(リンゴ) / 予防的

【表12】

活性化合物	活性化合物の施用量(ppm 有効成分)	効力(%)	
		実測値*	計算値**
(I-1) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	100 50	0 0	
(I-5) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	100 50	0 0	
(I-6) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	100 50	38 13	
3.22 トリフロキシストロビン	0.25	0	
5.8 オキシ塩化銅	50	54	
5.16 ホルペット	10	43	
5.30 硫黄	200	39	
15.60 2,6-ジメチル-1H,5H-[1,4]ジチイノ[2,3-c:5,6-c']ジピロール-1,3,5,7(2H,6H)-テトロン	25	54	
(I-1)+3.22 200:1	50+0.25	82	0
(I-6)+3.22 200:1	50+0.25	81	13
(I-5)+5.8 2:1	100+50	64	54
(I-1)+5.16 10:1	100+10	70	43
(I-5)+5.16 10:1	100+10	78	43
(I-1)+5.30 1:4	50+200	100	39
(I-6)+5.30 1:4	50+200	100	47
(I-5)+15.60 2:1	50+25	78	54

*実測値=実測活性

**計算値=コルベーの式を用いて計算した活性

実施例ボトリチス試験(ダイズ) / 預防的

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

10

20

30

40

50

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

好適な活性化合物製剤を製造するため、活性化合物 1 重量部を指定量の溶媒および乳化剤と混和し、濃厚液を水で希釈して所望の濃度とする。

【0269】

予防活性について調べるため、若い植物に活性化合物製剤を噴霧する。噴霧コーティングを乾燥させた後、増殖したボトリチス・シネレア (*Botrytis cinerea*) で覆われた寒天小片 2 個を各葉の上に置く。接種された植物を、20 および相対空気湿度 100 % の暗チャンバに入れること。

【0270】

接種から 2 日後に、葉表面の病変の大きさを評価する。0 % は未処理対照の効力に相当する効力を意味し、100 % の効力は疾患が認められないことを意味する。 10

【0271】

接種から 10 日後に試験を評価する。0 % は未処理対照の効力に相当する効力を意味し、100 % の効力は疾患が認められないことを意味する。

【0272】

表 12

ボトリチス試験 (ダイズ) / 予防的

【0273】

【表13】

活性化合物	活性化合物の施用量(ppm 有効成分)	効力(%)	
		実測値*	計算値**
(I-1) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロピ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	50 25	15 15	
(I-5) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロピ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	100 25	38 10	
5.4 クロロタロニル	5	8	
5.16 ホルペット	10	31	
5.23 マンコゼブ	5	0	
7.7 ピリメタニル	10	15	
(I-1)+5.4 5:1	25+5	50	22
(I-5)+5.4 5:1	25+5	80	17
(I-5)+5.16 10:1	100+10	73	57
(I-1)+5.23 10:1	50+5	55	15
(I-1)+7.7 5:1	50+10	65	28

*実測値=実測活性

**計算値=コルビーの式を用いて計算した活性

実施例スフェロテカ (Sphaerotilus) 試験 (キュウリ) / 予防的

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

好適な活性化合物製剤を製造するため、活性化合物 1 重量部を指定量の溶媒および乳化剤と混和し、濃厚液を水で希釈して所望の濃度とする。

【0274】

予防活性について調べるため、若い植物に活性化合物製剤を所定の施用量で噴霧する。噴霧コーティングを乾燥させた後、植物にスフェロテカ・フリギネア (Sphaerotilus fuliginea) の水系胞子懸濁液を接種する。次に、植物を、約 23

10

20

30

40

50

および相対空気湿度約70%の温室に入れる。

【0275】

接種から7日後に、試験を評価する。0%は未処理対照の効力に相当する効力を意味し、100%の効力は疾患が認められないことを意味する。

【0276】

接種から10日後に試験を評価する。0%は未処理対照の効力に相当する効力を意味し、100%の効力は疾患が認められないことを意味する。

【0277】

表13

スフェロテカ試験(キュウリ)/予防的

10

【0278】

【表14】

活性化合物	活性化合物の施用量(ppm 有効成分)	効力(%)	
		実測値*	計算値**
(I-1) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	50	0	
(I-6) 2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロブ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン	50	0	
2.2 ボスカリド	25	67	
(I-1)+2.2 2:1	50+25	93	67
(I-6)+2.2 2:1	50+25	83	67

20

30

*実測値=実測活性

**計算値=コルビーの式を用いて計算した活性

40

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International application No PCT/EP2012/060508									
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. A01N43/78 A01N43/80 A01P3/00 C07D417/14 A01N25/00 ADD.											
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC											
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) A01N C07D											
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched											
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, CHEM ABS Data, BEILSTEIN Data, WPI Data											
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT <table border="1" style="width: 100%; border-collapse: collapse;"> <thead> <tr> <th style="text-align: left; padding: 2px;">Category*</th> <th style="text-align: left; padding: 2px;">Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages</th> <th style="text-align: left; padding: 2px;">Relevant to claim No.</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td style="text-align: center; padding: 2px;">X</td> <td style="padding: 2px;">WO 2008/013622 A2 (DU PONT [US]; PASTERIS ROBERT JAMES [US]; HANAGAN MARY ANN [US]; SHAPI) 31 January 2008 (2008-01-31) page 98 - page 101; table 1A page 240, line 31 - page 243, line 8; claims; examples -----</td> <td style="text-align: center; padding: 2px;">1-12</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center; padding: 2px;">X</td> <td style="padding: 2px;">WO 2008/091594 A2 (DU PONT [US]; BRUHN JOHN ANTHONY [US]; PASTERIS ROBERT JAMES [US]) 31 July 2008 (2008-07-31) page 13, line 35 - page 22, line 7; claims; examples; table 4 ----- -/-</td> <td style="text-align: center; padding: 2px;">1-12</td> </tr> </tbody> </table>			Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.	X	WO 2008/013622 A2 (DU PONT [US]; PASTERIS ROBERT JAMES [US]; HANAGAN MARY ANN [US]; SHAPI) 31 January 2008 (2008-01-31) page 98 - page 101; table 1A page 240, line 31 - page 243, line 8; claims; examples -----	1-12	X	WO 2008/091594 A2 (DU PONT [US]; BRUHN JOHN ANTHONY [US]; PASTERIS ROBERT JAMES [US]) 31 July 2008 (2008-07-31) page 13, line 35 - page 22, line 7; claims; examples; table 4 ----- -/-	1-12
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.									
X	WO 2008/013622 A2 (DU PONT [US]; PASTERIS ROBERT JAMES [US]; HANAGAN MARY ANN [US]; SHAPI) 31 January 2008 (2008-01-31) page 98 - page 101; table 1A page 240, line 31 - page 243, line 8; claims; examples -----	1-12									
X	WO 2008/091594 A2 (DU PONT [US]; BRUHN JOHN ANTHONY [US]; PASTERIS ROBERT JAMES [US]) 31 July 2008 (2008-07-31) page 13, line 35 - page 22, line 7; claims; examples; table 4 ----- -/-	1-12									
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C.		<input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.									
* Special categories of cited documents : "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed											
"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "S" document member of the same patent family											
Date of the actual completion of the international search 21 June 2012		Date of mailing of the international search report 03/07/2012									
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Butkowskyj-Walkiw, T									

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2012/060508

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X, P	WO 2011/076699 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; CRISTAU PIERRE [FR]; HOFFMANN SEBASTIAN [DE]) 30 June 2011 (2011-06-30) cited in the application page 47, line 21 - page 48, line 15; table 1; compounds I-21, I-22, I-39 -----	1,2,5-12
A	US 2011/105429 A1 (CRISTAU PIERRE [DE] ET AL) 5 May 2011 (2011-05-05) paragraphs [0295], [0356] - [0361]; claims; examples -----	1-12
A	WO 2011/051244 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; CRISTAU PIERRE [FR]; RAHN NICOLA [DE]; TSUC) 5 May 2011 (2011-05-05) page 77, line 11 - line 15; claims; examples page 81, line 17 - line 22 page 100, line 1 - line 6 -----	1-12

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2012/060508

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)		Publication date
WO 2008013622	A2 31-01-2008	AR 063213 A1		14-01-2009
		AU 2007277157 A1		31-01-2008
		CA 2653640 A1		31-01-2008
		CL 21852007 A1		13-06-2008
		CN 101888843 A		17-11-2010
		CO 6150154 A2		20-04-2010
		EP 2049111 A2		22-04-2009
		GE P20125505 B		25-04-2012
		JP 2010509190 A		25-03-2010
		KR 20090033496 A		03-04-2009
		ME 00586 A		20-12-2011
		PE 09522008 A1		10-09-2008
		RU 2009106871 A		10-09-2010
		TW 200822865 A		01-06-2008
		US 2009156592 A1		18-06-2009
		UY 30510 A1		29-02-2008
		WO 2008013622 A2		31-01-2008
WO 2008091594	A2 31-07-2008	NONE		
WO 2011076699	A1 30-06-2011	US 2011224257 A1		15-09-2011
		WO 2011076699 A1		30-06-2011
US 2011105429	A1 05-05-2011	AU 2009243401 A1		05-11-2009
		CA 2722775 A1		05-11-2009
		CO 6311101 A2		22-08-2011
		EA 201001699 A1		29-04-2011
		EP 2280965 A1		09-02-2011
		JP 2011523938 A		25-08-2011
		KR 20100135952 A		27-12-2010
		US 2011105429 A1		05-05-2011
		WO 2009132785 A1		05-11-2009
WO 2011051244	A1 05-05-2011	TW 201127287 A		16-08-2011
		US 2011306620 A1		15-12-2011
		WO 2011051244 A1		05-05-2011

フロントページの続き

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード(参考)
A 01N 57/12 (2006.01)	A 01N 57/12	H
A 01N 59/26 (2006.01)	A 01N 59/26	
A 01N 43/50 (2006.01)	A 01N 43/90	103
A 01N 59/20 (2006.01)	A 01N 43/50	Q
A 01N 47/04 (2006.01)	A 01N 59/20	Z
A 01N 55/02 (2006.01)	A 01N 47/04	101
A 01N 47/26 (2006.01)	A 01N 55/02	B
A 01N 47/12 (2006.01)	A 01N 47/26	
A 01N 43/54 (2006.01)	A 01N 47/12	Z
A 01N 43/88 (2006.01)	A 01N 43/54	D
A 01N 47/24 (2006.01)	A 01N 43/54	A
A 01N 37/50 (2006.01)	A 01N 43/88	
A 01N 59/02 (2006.01)	A 01N 47/24	G
A 01N 43/76 (2006.01)	A 01N 37/50	
A 01N 43/56 (2006.01)	A 01N 59/02	A
A 01N 37/34 (2006.01)	A 01N 43/50	M
	A 01N 43/76	
	A 01N 43/40	101C
	A 01N 55/02	G
	A 01N 43/56	C
	A 01N 43/40	101D
	A 01N 43/40	101A
	A 01N 37/34	104

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

(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 ホフマン, セバスチヤン

ドイツ国、41470・ノイス、ファーンヴェーク・7

(72) 発明者 バスナイレ, ピエール

ドイツ国、40225・デュッセルドルフ、クリストフシュトラーセ・55

(72) 発明者 ヴァツヘンドルフ - ノイマン, ウルリケ

ドイツ国、56566・ノイヴィート、オーベラー・マーケンベーグ・85

F ターム(参考) 4H011 AA01 BA01 BA06 BB06 BB09 BB10 BB13 BB14 BB17 BB18

BB19 BC05 BC06 BC19 DC05 DD03 DE15 DF04 DH03