(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2014-534251
(P2014-534251A)
(43)公表日　平成26年12月18日(2014.12.18)

(51)Int.Cl.		F I		テーマコード（参考）
C07D 233/68	(2006.01)	C07D 233/68	CSP	4C063
C07D 405/06	(2006.01)	C07D 405/06		4H011
A01N 43/50	(2006.01)	A01N 43/50	C	
A01P 3/00	(2006.01)	A01N 43/50	G	
		A01P 3/00		

審査請求 未請求　予備審査請求 未請求　（全 75 頁）

(21)出願番号　特願2014-542841 (P2014-542841)
(86)(22)出願日　平成24年11月23日 (2012.11.23)
(85)翻訳文提出日　平成26年7月18日 (2014.7.18)
(86)国際出願番号　PCT/EP2012/073427
(87)国際公開番号　WO2013/076228
(87)国際公開日　平成25年5月30日 (2013.5.30)
(31)優先権主張番号　11190683.0
(32)優先日　平成23年11月25日 (2011.11.25)
(33)優先権主張国　欧州特許庁 (EP)

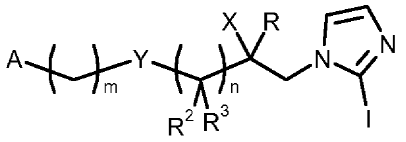
(71)出願人　512151078
バイエル・インテレクチユアル・プロパテイー・ゲー・エム・ベー・ハー
ドイツ国、４０７８９・モンハイム、アルフレート－ノベル－シュトラーセ・１０
(74)代理人　100114188
弁理士　小野　誠
(74)代理人　100119253
弁理士　金山　賢教
(74)代理人　100124855
弁理士　坪倉　道明
(74)代理人　100129713
弁理士　重森　一輝
(74)代理人　100137213
弁理士　安藤　健司

最終頁に続く

(54)【発明の名称】２－ヨードイミダゾール誘導体

(57)【要約】
本発明は、新規な２－ヨードイミダゾール誘導体、該化合物の調製方法、該化合物を含んだ組成物、並びに、生物学的活性化合物、特に、植物保護及び材料物質の保護において有害微生物を防除するための生物学的活性化合物としての、及び、植物成長調節剤としてのそれらの使用に関する。
【選択図】なし

【特許請求の範囲】
【請求項１】
式（Ｉ）
【化１】



(I)

〔式中、
Ｘは、ＯＲ^{1}、ＣＮ又は水素を表し；
Ｙは、Ｏ、Ｓ、ＳＯ、ＳＯ$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$－又は直接結合を表し；
ｍは、０又は１を表し；
ｎは、０又は１を表し；
Ｒは、各々の場合において、任意に置換されたアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル又はアリールを表し；
Ｒ^{1}は、水素、任意に置換されたアルキルカルボニル又はトリアルキルシリルを表し；
Ｒ^{2}は、水素、ハロゲン又は任意に置換されたアルキルを表し；
Ｒ^{3}は、水素、ハロゲン又は任意に置換されたアルキルを表し；
Ｒ^{2}とＲ^{3}とは、共に、任意に置換されたＣ$_{2}$－Ｃ$_{5}$－アルキレンを更に表してもよく；
ＲとＲ^{2}とは、共に、任意に置換されたＣ$_{2}$－Ｃ$_{5}$－アルキレンを更に表してもよく；
ＲとＲ^{1}とは、共に、各々の場合において、ハロゲン－、アルキル－又はハロアルキルで任意に置換されたＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキレン又はＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキレンオキシ（ここで、この基の酸素は、任意に置換されたテトラヒドロフラン－２－イル環、１，３－ジオキセタン－２－イル環、１，３－ジオキソラン－２－イル環、１，３－ジオキサン－２－イル環又は１，３－ジオキセパン－２－イル環を形成するように、Ｒに結合している）を更に表してもよく；
Ｒ^{1}とＲ^{2}とは、ｎが１を表す場合には、直接結合を更に表してもよく；
ＹとＲ^{3}とは、ｍ及びｎが両方とも１を表す場合には、共に、更に、二重結合を形成してもよく；
Ａは、任意に置換されたアリール又は任意に置換されたヘテロアリールを表す〕
で表される２－ヨードイミダゾール誘導体及びそれらの農薬的に活性な塩。
【請求項２】
Ｘが、ＯＲ^{1}を表し；
Ｙが、Ｏ、Ｓ、ＳＯ$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$－又は直接結合を表し；
ｍが、０又は１を表し；
ｎが、０又は１を表し；
Ｒが、各々の場合において、任意に分枝したＣ$_{3}$－Ｃ$_{7}$－アルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{8}$－ハロアルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{7}$－アルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{7}$－ハロアルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{7}$－アルキニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{7}$－ハロアルキニル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$－アルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルコキシ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$－アルキル、トリ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$－アルキル）シリル－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$－アルキル、各々の場合において、ハロゲン－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルキル－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルコキシ－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルキルチオ－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルチオ－又はフェノキシ（ここで、フェノキシも、ハロゲン又はＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルで置換されていてもよい）で任意に置換されたＣ$_{3}$－Ｃ$_{7}$－シクロアルキル又はＣ$_{3}$－Ｃ$_{7}$－シクロアルキル－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$－アルキル（ここで、任意の置換は、該シクロアルキル部分において成されている）、及び、ハロゲン－又はＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルで任意に１～３置換されていたフェニルを表し；

R^1が、水素、（C_1－C_3－アルキル）カルボニル、（C_1－C_3－ハロアルキル）カルボニル又はトリ（C_1－C_3－アルキル）シリルを表し；
R^2が、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、C_1－C_4－アルキル又はC_1－C_4－ハロアルキルを表し；
R^3が、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、C_1－C_4－アルキル又はC_1－C_4－ハロアルキルを表し；
R^2とR^3とが、共に、直鎖又は分枝鎖であり、且つ、ハロゲン（特に、フッ素、塩素又は臭素）で任意に置換されたC_2－C_5－アルキレンを更に表し；
RとR^2とが、共に、直鎖又は分枝鎖であり、且つ、ハロゲン又はC_1－C_4－アルキル（特に、フッ素、塩素、臭素又はメチル）で任意に置換されたC_2－C_5－アルキレンを更に表し；
RとR^1とが、共に、フッ素－、塩素－、臭素－、C_1－C_4－アルキル－又はC_1－C_4－ハロアルキルで任意に置換された－（CH_2）$_3$－、－CH_2O－、－（CH_2）$_2O$－、－（CH_2）$_3O$－（ここで、この基の酸素は、各々の場合において、任意に置換されたテトラヒドロフラン－２－イル環、１，３－ジオキセタン－２－イル環、１，３－ジオキソラン－２－イル環又は１，３－ジオキサン－２－イル環が形成されるように、Rに結合している）を更に表し；
R^1とR^2とは、ｎが１を表す場合には、直接結合を更に表してもよく；
YとR^3とは、ｍ及びｎが両方とも１を表す場合には、共に、更に、二重結合を形成してもよく；
Aが、置換されていないフェニルを表すか、又は、Z^1で１～３置換されたフェニルを表し、式中、Z^1は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ＯＨ、ＳＨ、Ｃ（アルキル）（＝ＮＯアルキル）、C_3－C_7－シクロアルキル、C_3－C_6－シクロアルキル－C_1－C_2－アルキル、C_1－C_4－アルキル、C_1－C_4－ハロアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、C_1－C_4－ハロアルコキシ、C_1－C_4－アルキルチオ、C_1－C_4－ハロアルキルチオ、C_2－C_4－アルケニル、C_2－C_4－ハロアルケニル、C_2－C_4－アルキニル、C_2－C_4－ハロアルキニル、C_1－C_4－アルキルスルフィニル、C_1－C_4－ハロアルキルスルフィニル、C_1－C_4－アルキルスルホニル、C_1－C_4－ハロアルキルスルホニル、C_1－C_4－アルキルスルホニルオキシ、ホルミル、C_2－C_5－アルキルカルボニル、C_2－C_5－ハロアルキルカルボニル、C_2－C_5－アルコキシカルボニル、C_2－C_5－ハロアルコキシカルボニル、C_3－C_6－アルケニルオキシ、C_3－C_6－アルキニルオキシ、C_2－C_5－アルキルカルボニルオキシ、C_2－C_5－ハロアルキルカルボニルオキシ、トリアルキルシリルを表すか、又は、各々の場合において、ハロゲン－、C_1－C_4－アルキル－、C_1－C_4－ハロアルキル－、C_1－C_4－アルコキシ－若しくはC_2－C_4－アルキルカルボニルで任意に１置換されたフェニル、フェノキシ若しくはフェニルチオを表し；
又は、
Aが、各々の場合において、Z^2で１置換又は多置換された５員又は６員のヘテロアリール（該ヘテロアリールは、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル及びトリアジニルから選択される）を表し、式中、Z^2は、ハロゲン、C_1－C_4－アルキル、C_1－C_4－アルキルチオ、C_1－C_4－アルコキシ、C_1－C_4－ハロアルキル、C_1－C_4－ハロチオアルキル、C_1－C_4－ハロアルコキシ、C_3－C_7－シクロアルキル、各々の場合において、ハロゲン－若しくはC_1－C_4－アルキルで任意に置換されたフェニル、フェノキシ若しくはフェニルチオを表す；
請求項１に記載の式（Ｉ）で表される２－ヨードイミダゾール誘導体及びそれらの農薬的に活性な塩。
【請求項３】
請求項１又は２に記載の式（Ｉ）で表される２－ヨードイミダゾール誘導体を、有害な

植物病原性菌類及び／又はそれらの生息環境に施用することを特徴とする、有害植物病原性菌類の防除方法。
【請求項４】
増量剤及び／又は界面活性剤に加え、請求項１又は２に記載の式（Ｉ）で表される２－ヨードイミダゾール誘導体のうちの少なくとも１つを含んでいることを特徴とする、有害植物病原性菌類防除用組成物。
【請求項５】
有害な植物病原性菌類を防除するための、請求項１又は２に記載の式（Ｉ）で表される２－ヨードイミダゾール誘導体の使用。
【請求項６】
植物成長調節剤としての、請求項１又は２に記載の式（Ｉ）で表される２－ヨードイミダゾール誘導体の使用。
【請求項７】
請求項１又は２に記載の式（Ｉ）で表される２－ヨードイミダゾール誘導体を、増量剤及び／又は界面活性剤と混合させることを特徴とする、有害植物病原性菌類防除用組成物の製造方法。
【請求項８】
トランスジェニック植物を処理するための、請求項１に記載の式（Ｉ）で表される２－ヨードイミダゾール誘導体の使用。
【請求項９】
種子及びトランスジェニック植物の種子を処理するための、請求項１に記載の式（Ｉ）で表される２－ヨードイミダゾール誘導体の使用。
【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
本発明は、新規な２－ヨードイミダゾール誘導体、これらの化合物の調製方法、これらの化合物を含んだ組成物、並びに、生物学的活性化合物、特に、作物保護及び材料物質（ｍａｔｅｒｉａｌｓ）の保護において有害微生物を防除するための生物学的活性化合物としての、及び、植物成長調節剤としての、それらの使用に関する。
【背景技術】
【０００２】
特定の２－ヨードイミダゾール誘導体を、作物保護における殺菌剤として又は皮膚糸状菌に対する抗真菌剤として使用することができるということは既に知られている（ｃｆ．ＷＯ　８７／０６４３０；Ｊ．　Ｍｅｄ．　Ｃｈｅｍ．　１９９７，　４０，　２６０９－２６２５；Ｂｉｏｐｏｌｙｍｅｒｓ　１９９７，　４３，　４３－７１）。さらに、２位がハロゲンで置換されている別のイミダゾール誘導体は、殺有害生物剤として知られている（ｃｆ．　ＥＰ－Ａ　０４１２８４９）。
【先行技術文献】
【特許文献】
【０００３】
【特許文献１】国際特許出願公開第８７／０６４３０号
【特許文献２】欧州特許出願公開第０４１２８４９号
【非特許文献】
【０００４】
【非特許文献１】Ｊ．　Ｍｅｄ．　Ｃｈｅｍ．　１９９７，　４０，　２６０９－２６２５
【非特許文献２】Ｂｉｏｐｏｌｙｍｅｒｓ　１９９７，　４３，　４３－７１
【発明の概要】
【発明が解決しようとする課題】
【０００５】

現代の活性化合物（例えば、殺菌剤）に求められる生態学的及び経済学的な要求、例えば、活性スペクトル、毒性、選択性、施用量、残留物の形成及び好ましい製造方法などに関する要求は、継続的に増大しており、また、例えば抵抗性に関する問題も存在し得るので、少なくとも一部の領域において既知組成物よりも有利な新規殺菌剤組成物を開発することが絶えず求められている。

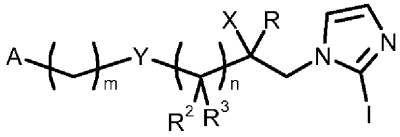
【課題を解決するための手段】

【０００６】

本発明は、式（Ｉ）

【０００７】

【化１】



(I)

〔式中、

Ｘは、ＯＲ[1]、ＣＮ又は水素を表し；

Ｙは、Ｏ、Ｓ、ＳＯ、SO_2、$-CH_2-$又は直接結合を表し；

ｍは、０又は１を表し；

ｎは、０又は１を表し；

Ｒは、各々の場合において、任意に置換されたアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル又はアリールを表し；

Ｒ[1]は、水素、任意に置換されたアルキルカルボニル又はトリアルキルシリルを表し；

Ｒ[2]は、水素、ハロゲン又は任意に置換されたアルキルを表し；

Ｒ[3]は、水素、ハロゲン又は任意に置換されたアルキルを表し；

Ｒ[2]とＲ[3]とは、共に、任意に置換されたC_2-C_5－アルキレンをさらに表してもよく；

ＲとＲ[2]とは、共に、任意に置換されたC_2-C_5－アルキレンをさらに表してもよく；

ＲとＲ[1]とは、共に、各々の場合において、ハロゲン－、アルキル－又はハロアルキルで任意に置換されたC_1-C_4－アルキレン又はC_1-C_4－アルキレンオキシ（ここで、この基の酸素は、任意に置換されたテトラヒドロフラン－２－イル環、１，３－ジオキセタン－２－イル環、１，３－ジオキソラン－２－イル環、１，３－ジオキサン－２－イル環又は１，３－ジオキセパン－２－イル環を形成するように、Ｒに結合している）を更に表してもよく；

Ｒ[1]とＲ[2]とは、ｎが１を表す場合には、直接結合を更に表してもよく；

ＹとＲ[3]とは、ｍ及びｎが両方とも１を表す場合には、共に、更に、二重結合を形成してもよく；

Ａは、任意に置換されたアリール又は任意に置換されたヘテロアリールを表す〕

で表される新規２－ヨードイミダゾール誘導体及びそれらの農薬的に活性な塩を提供する。

【０００８】

入手可能な塩も、同様に、殺菌特性及び／又は植物成長調節特性を有している。

【発明を実施するための形態】

【０００９】

本発明に従って使用し得るヘテロ環式チオ置換アルカノール誘導体は、概して、式（Ｉ）によって定義される。上記及び下記において特定されている式に関する好ましいラジカルは、以下で定義される。これらの定義は、式（Ｉ）で表される最終生成物及び全ての中間体に等しく適用される（以下の「調製方法及び中間体についての説明」も参照されたい）。

【００１０】
Ｘは、好ましくは、ＯＲ^{1}を表す。
【００１１】
Ｙは、好ましくは、Ｏを表す。
【００１２】
Ｙは、同様に、好ましくは、－ＣＨ$_{2}$－を表す。
【００１３】
Ｙは、同様に、好ましくは、直接結合を表す。
【００１４】
Ｙは、同様に、好ましくは、Ｓ又はＳＯ$_{2}$を表す。
【００１５】
Ｙは、特に好ましくは、酸素を表す。
【００１６】
Ｙは、同様に、特に好ましくは、ＣＨ$_{2}$－を表す。
【００１７】
Ｙは、同様に、特に好ましくは、直接結合を表す。
【００１８】
ｍは、好ましくは、０を表す。
【００１９】
ｍは、同様に、好ましくは、１を表す。
【００２０】
ｎは、好ましくは、０を表す。
【００２１】
ｎは、同様に、好ましくは、１を表す。
【００２２】
Ｒは、好ましくは、各々の場合において、任意に分枝したＣ$_{3}$－Ｃ$_{7}$－アルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{8}$－ハロアルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{7}$－アルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{7}$－ハロアルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{7}$－アルキニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{7}$－ハロアルキニル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$－アルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルコキシ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$－アルキル、トリ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$－アルキル）シリル－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$－アルキル、各々の場合においてハロゲン－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルキル－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルコキシ－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルキルチオ－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルチオ－又はフェノキシ（ここで、フェノキシも、ハロゲン又はＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルで置換されていてもよい）で任意に置換されたＣ$_{3}$－Ｃ$_{7}$－シクロアルキル又はＣ$_{3}$－Ｃ$_{7}$－シクロアルキル－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$－アルキル（ここで、任意の置換は、該シクロアルキル部分において成されている）、及び、ハロゲン－又はＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルで任意に１～３置換されたフェニルを表す。
【００２３】
Ｒは、特に好ましくは、各々の場合において、任意に分枝したＣ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－アルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$－ハロアルキル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{5}$－アルケニル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{5}$－ハロアルケニル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{5}$－アルキニル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{5}$－ハロアルキニル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$－アルコキシ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{2}$－アルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{3}$－ハロアルコキシ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{2}$－アルキル、トリ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{2}$－アルキル）シリル－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{2}$－アルキル、各々の場合においてハロゲン－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルキル－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルコキシ－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルキルチオ－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルチオ－又はフェノキシ（ここで、フェノキシも、フッ素、塩素、臭素又はＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルで置換されていてもよい）で任意に置換されたＣ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－シクロアルキル又はＣ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－シクロアルキル－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{2}$－アルキル（ここで、任意の置換は、該シクロアルキル部分において成されている）、及び、ハロゲン－又はＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルで任意に１～３置換されたフェニルを表す。

【００２４】
Ｒは、極めて特に好ましくは、ｔｅｒｔ－ブチル、イソプロピル、１，１，２，２－テトラフルオロエトキシメチル、トリメチルシリルメチル、１－クロロシクロプロピル、１－フルオロシクロプロピル、１－メチルシクロプロピル、１－メトキシシクロプロピル、１－メチルチオシクロプロピル、１－トリフルオロメチルシクロプロピル、１－フェノキシシクロプロピル、１－（２－クロロフェノキシ）シクロプロピル、１－（２－フルオロフェノキシ）シクロプロピル、１－（４－フルオロフェノキシ）シクロプロピル、１－（２，４－ジフルオロフェノキシ）シクロプロピル、（３Ｅ）－４－クロロ－２－メチルブタ－３－エン－２－イル、C_1－C_4－ハロアルキル、シクロプロピルメチル、１－シクロプロピルエチル、２－シクロプロピルエチル、１－フルオロフェニル、４－クロロ－２－フルオロフェニル、２，４－ジフルオロフェニルを表す。
【００２５】
R^1は、好ましくは、水素、（C_1－C_3－アルキル）カルボニル、（C_1－C_3－ハロアルキル）カルボニル又はトリ（C_1－C_3－アルキル）シリルを表す。
【００２６】
R^1は、特に好ましくは、水素、メチルカルボニル又はトリメチルシリルを表す。
【００２７】
R^1は、極めて特に好ましくは、水素を表す。
【００２８】
R^2は、好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、C_1－C_4－アルキル又はC_1－C_4－ハロアルキルを表す。
【００２９】
R^2は、特に好ましくは、水素、フッ素、塩素、メチル、エチル又はトリフルオロメチルを表す。
【００３０】
R^2は、極めて特に好ましくは、水素又はメチルを表す。
【００３１】
R^3は、好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、C_1－C_4－アルキル又はC_1－C_4－ハロアルキルを表す。
【００３２】
R^3は、特に好ましくは、水素、フッ素、塩素、メチル、エチル又はトリフルオロメチルを表す。
【００３３】
R^3は、極めて特に好ましくは、水素又はメチルを表す。
【００３４】
R^2とR^3とは、共に、好ましくは、直鎖又は分枝鎖であり、且つ、ハロゲン（特に、フッ素、塩素又は臭素）で任意に置換されたC_2－C_5－アルキレンを更に表す。
【００３５】
R^2とR^3とは、共に、特に好ましくは、－（CH_2）$_2$－、－（CH_2）$_4$－、－（CH_2）$_5$－又は－（CH_2）CH（CH_3）－を更に表す。
【００３６】
ＲとR^2とは、共に、好ましくは、直鎖又は分枝鎖であり、且つ、ハロゲン又はC_1－C_4－アルキル（特に、フッ素、塩素、臭素又はメチル）で任意に置換されたC_2－C_5－アルキレンを更に表す。
【００３７】
ＲとR^2とは、共に、特に好ましくは、－（CH_2）$_2$－、－（CH_2）$_4$－、－（CH_2）$_5$－、－（CH_2）$_2$C（CH_3）$_2$、－C（CH_3）$_2$（CH_2）$_2$－又は－（CH_2）CH（CH_3）－を更に表す。
【００３８】
ＲとR^2とは、共に、極めて特に好ましくは、－（CH_2）$_2$－を更に表す。

【００３９】
ＲとＲ^{1}とは、共に、好ましくは、フッ素－、塩素－、臭素－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル－又はＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルキルで任意に置換された－（ＣＨ$_{2}$）$_{3}$－、－ＣＨ$_{2}$Ｏ－、－（ＣＨ$_{2}$）$_{2}$Ｏ－、－（ＣＨ$_{2}$）$_{3}$Ｏ－（ここで、この基の酸素は、各々の場合において、任意に置換されたテトラヒドロフラン－２－イル環、１，３－ジオキセタン－２－イル環、１，３－ジオキソラン－２－イル環又は１，３－ジオキサン－２－イル環が形成されるように、Ｒに結合している）を更に表す。
【００４０】
ＲとＲ^{1}とは、共に、特に好ましくは、メチル－、エチル－、ｎ－プロピル－、ｎ－ブチルで任意に置換された－（ＣＨ$_{2}$）$_{2}$Ｏ－（ここで、この基の酸素は、任意に置換された１，３－ジオキソラン－２－イルが形成されるように、Ｒに結合している）を更に表す。
【００４１】
Ｒ^{1}とＲ^{2}とは、ｎが１を表す場合には、好ましくは、直接結合を更に表してもよい。
【００４２】
Ａは、好ましくは、置換されていないフェニルを表すか、又は、Ｚ^{1}で１～３置換されたフェニルを表し、式中、
Ｚ^{1}は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ＯＨ、ＳＨ、Ｃ（アルキル）（＝ＮＯアルキル）、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{7}$－シクロアルキル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－シクロアルキル－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{2}$－アルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルコキシ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルチオ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルキルチオ、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{4}$－アルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{4}$－アルキニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルキニル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルスルフィニル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルキルスルフィニル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルスルホニル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルキルスルホニル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルスルホニルオキシ、ホルミル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{5}$－アルキルカルボニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{5}$－ハロアルキルカルボニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{5}$－アルコキシカルボニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{5}$－ハロアルコキシカルボニル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－アルケニルオキシ、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－アルキニルオキシ、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{5}$－アルキルカルボニルオキシ、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{5}$－ハロアルキルカルボニルオキシ、トリアルキルシリルを表すか、或いは、各々の場合においてハロゲン－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルキル－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ－若しくはＣ$_{2}$－Ｃ$_{4}$－アルキルカルボニルで１置換されたフェニル、フェノキシ又はフェニルチオを表す。
【００４３】
Ａは、特に好ましくは、置換されていないフェニルを表すか、又は、Ｚ^{1}で１～３置換されたフェニルを表し、式中、
Ｚ^{1}は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、Ｃ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{5}$－アルキル）（＝ＮＯ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{5}$－アルキル））、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－シクロアルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルコキシ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルチオ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルキルチオ、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{4}$－アルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{4}$－アルキニル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルスルフィニル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルスルホニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{5}$－アルキルカルボニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{5}$－アルコキシカルボニル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－アルケニルオキシ、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－アルキニルオキシ、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{5}$－アルキルカルボニルオキシを表すか、或いは、各々の場合においてハロゲン－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロアルキル－、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ－若しくはＣ$_{2}$－Ｃ$_{4}$－アルキルカルボニルで任意に１置換されたフェニル、フェノキシ又はフェニルチオを表す。
【００４４】
Ａは、極めて特に好ましくは、置換されていないフェニルを表すか、又は、Ｚ^{1}で１～３置換されたフェニルを表し、式中、
Ｚは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、Ｃ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）（＝ＮＯ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル））、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－シクロアルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{2}$－

ハロアルキル、C_1－C_2－アルコキシ、C_1－C_2－ハロアルコキシ、C_1－C_2－アルキルチオ、C_1－C_2－ハロアルキルチオ、C_1－C_2－アルキルスルフィニル、C_1－C_2－アルキルスルホニル、アセチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルカルボニルオキシを表すか、或いは、各々の場合において、ハロゲン－、C_1－C_2－アルキル－、C_1－C_2－ハロアルキル－、C_1－C_2－アルコキシ－、アセチルで任意に１置換されたフェニル、フェノキシ又はフェニルチオを表す。

【００４５】

Ａは、とりわけ好ましくは、置換されていないフェニルを表すか、又は、Z^1で１～３置換されたフェニルを表し、式中、

Z^1は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、ＣＨ（＝ＮＯＭｅ）、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソプロピル、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル、ｓ－ブチル、ｔ－ブチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、ジフルオロクロロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、メチルチオ、トリフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオを表すか、或いは、各々の場合においてフッ素－、塩素－、臭素－、ヨウ素－、メチル－、エチル－、トリフルオロメチル－、トリクロロメチル－、ジフルオロメチル－、ジクロロメチル－、ジフルオロクロロメチル－、メトキシ－、アセチルで１置換されたフェニル、フェノキシ又はフェニルチオを表す。

【００４６】

Ａは、同様に、好ましくは、各々の場合においてZ^2で任意に１置換又は多置換された５員又は６員のヘテロアリール（該ヘテロアリールは、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル及びトリアジニルから選択される）を表し、式中、

Z^2は、ハロゲン、C_1－C_4－アルキル、C_1－C_4－アルキルチオ、C_1－C_4－アルコキシ、C_1－C_4－ハロアルキル、C_1－C_4－ハロチオアルキル、C_1－C_4－ハロアルコキシ、C_3－C_7－シクロアルキルを表すか、或いは、各々の場合においてハロゲン－若しくはC_1－C_4－アルキルで置換されていてもよいフェニル、フェノキシ又はフェニルチオを表す。

【００４７】

Ａは、同様に、特に好ましくは、各々の場合においてZ^2で任意に１置換又は多置換された５員又は６員のヘテロアリール（該ヘテロアリールは、２－フリル、３－フリル、２－チエニル、３－チエニル、２－ピロリル、３－ピロリル、１－ピロリル、３－ピラゾリル、４－ピラゾリル、５－ピラゾリル、１－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾール－２－イル、１Ｈ－イミダゾール－４－イル、１Ｈ－イミダゾール－５－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、２－オキサゾリル、４－オキサゾリル、５－オキサゾリル、２－チアゾリル、４－チアゾリル、５－チアゾリル、３－イソオキサゾリル、４－イソオキサゾリル、５－イソオキサゾリル、３－イソチアゾリル、４－イソチアゾリル、５－イソチアゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－５－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、４Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、４Ｈ－１，２，４－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－テトラゾール－１－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、２Ｈ－テトラゾール－２－イル、２Ｈ－テトラゾール－５－イル、１，２，４－オキサジアゾール－３－イル、１，２，４－オキサジアゾール－５－イル、１，２，４－チアジアゾール－３－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル、１，３，４－チアジアゾール－２－イル、１，２，３－オキサジアゾール－４－イル、１，２，３－オキサジアゾール－５－イル、１，２，３－チアジアゾール

－４－イル、１，２，３－チアジアゾール－５－イル、１，２，５－オキサジアゾール－３－イル、１，２，５－チアジアゾール－３－イル、２－ピリジニル、３－ピリジニル、４－ピリジニル、３－ピリダジニル、４－ピリダジニル、２－ピリミジニル、４－ピリミジニル、５－ピリミジニル、２－ピラジニル、１，３，５－トリアジン－２－イル、１，２，４－トリアジン－３－イル、１，２，４－トリアジン－５－イル、１，２，４－トリアジン－６－イルから選択される）を表し、式中、

Z^2は、ハロゲン、C_1－C_4－アルキル、C_1－C_2－アルキルチオ、C_1－C_2－アルコキシ、C_1－C_2－ハロアルキル、C_1－C_2－ハロチオアルキル、C_1－C_2－ハロアルコキシ、C_3－C_6－シクロアルキルを表すか、或いは、各々の場合においてハロゲン－若しくはC_1－C_4－アルキルで１置換されていてもよいフェニル又はフェノキシを表す。

【００４８】

Ａは、同様に、極めて特に好ましくは、各々の場合においてZ^2で任意に１置換又は多置換された５員又は６員のヘテロアリール（該ヘテロアリールは、２－フリル、３－フリル、２－チエニル、３－チエニル、２－ピロリル、３－ピロリル、１－ピロリル、３－ピラゾリル、４－ピラゾリル、５－ピラゾリル、２－イミダゾリル、４－イミダゾリル、５－イミダゾリル、２－オキサゾリル、４－オキサゾリル、５－オキサゾリル、２－チアゾリル、４－チアゾリル、５－チアゾリル、３－イソオキサゾリル、４－イソオキサゾリル、５－イソオキサゾリル、３－イソチアゾリル、４－イソチアゾリル、５－イソチアゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－テトラゾール－１－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、１，２，４－オキサジアゾール－３－イル、１，２，４－オキサジアゾール－５－イル、１，２，４－チアジアゾール－３－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル、１，３，４－チアジアゾール－２－イル、２－ピリジニル、３－ピリジニル、４－ピリジニル、３－ピリダジニル、４－ピリダジニル、２－ピリミジニル、４－ピリミジニル、５－ピリミジニル、２－ピラジニルから選択される）を表し、式中、

Z^2は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソプロピル、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル、ｓ－ブチル、ｔ－ブチル、シクロプロピル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリクロロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、ジフルオロメチルチオ、ジクロロメチル、ジフルオロクロロメチル、ジフルオロクロロメトキシを表し、

Z^2は、フッ素、塩素又はメチルで置換されたフェニルを更に表す。

【００４９】

しかしながら、一般論として提供されるか又は好ましい範囲内で記載されるラジカルの定義及び説明は、必要に応じて互いに組み合わせることも可能である、即ち、特定の範囲と好ましい範囲との組合せを包含する。それらはいずれも、最終生成物に適用され、同様に、前駆物質及び中間体にも適用される。さらに、個々の定義は適用しなくてもよい。

【００５０】

好ましいのは、式（Ｉ）〔式中、全てのラジカルは、各々の場合において、上記で記載された好ましい意味を有する〕で表される化合物である。

【００５１】

特に好ましいのは、式（Ｉ）〔式中、全てのラジカルは、各々の場合において、上記で記載されたさらに好ましい定義を有する〕で表される化合物である。

【００５２】

極めて特に好ましいのは、式（Ｉ）〔式中、全てのラジカルは、各々の場合において、上記で記載された最も好ましい定義を有する〕で表される化合物である。

【００５３】

上記式中に記載された記号の定義では、以下の置換基を一般に代表する総称を使用した：

ハロゲン：　（ハロアルキル、ハロアルコキシなどの組合せを包含する）フッ素、塩素、臭素、及び、ヨウ素；

アルキル：　（アルキルチオ、アルコキシなどの組合せを包含する）１～８個の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖の飽和ヒドロカルビルラジカル、例えば、C_1－C_6－アルキル、例えば、メチル、エチル、プロピル、１－メチルエチル、ブチル、１－メチルプロピル、２－メチルプロピル、１，１－ジメチルエチル、ペンチル、１－メチルブチル、２－メチルブチル、３－メチルブチル、２，２－ジメチルプロピル、１－エチルプロピル、ヘキシル、１，１－ジメチルプロピル、１，２－ジメチルプロピル、１－メチルペンチル、２－メチルペンチル、３－メチルペンチル、４－メチルペンチル、１，１－ジメチルブチル、１，２－ジメチルブチル、１，３－ジメチルブチル、２，２－ジメチルブチル、２，３－ジメチルブチル、３，３－ジメチルブチル、１－エチルブチル、２－エチルブチル、１，１，２－トリメチルプロピル、１，２，２－トリメチルプロピル、１－エチル－１－メチルプロピル、及び、１－エチル－２－メチルプロピル；ヘプチル、オクチル；

ハロアルキル：　（ハロアルキルチオ、ハロアルコキシなどの組合せを包含する）１～８個の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖のアルキル基（上記で記載したとおり）であって、これらの基内の水素原子の一部又は全部が上記で記載したハロゲン原子で置き換えられ得るもの、例えば、C_1－C_3－ハロアルキル、例えば、クロロメチル、ブロモメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、１－クロロエチル、１－ブロモエチル、１－フルオロエチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、２，２，２－トリフルオロエチル、２－クロロ－２－フルオロエチル、２－クロロ－２－ジフルオロエチル、２，２－ジクロロ－２－フルオロエチル、２，２，２－トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、及び、１，１，１－トリフルオロプロパ－２－イル；

アルケニル：　２～８個の炭素原子を有し、且つ、任意の位置に１つの二重結合を有する直鎖又は分枝鎖の不飽和ヒドロカルビルラジカル、例えば、C_2－C_6－アルケニル、例えば、エテニル、１－プロペニル、２－プロペニル、１－メチルエテニル、１－ブテニル、２－ブテニル、３－ブテニル、１－メチル－１－プロペニル、２－メチル－１－プロペニル、１－メチル－２－プロペニル、２－メチル－２－プロペニル、１－ペンテニル、２－ペンテニル、３－ペンテニル、４－ペンテニル、１－メチル－１－ブテニル、２－メチル－１－ブテニル、３－メチル－１－ブテニル、１－メチル－２－ブテニル、２－メチル－２－ブテニル、３－メチル－２－ブテニル、１－メチル－３－ブテニル、２－メチル－３－ブテニル、３－メチル－３－ブテニル、１，１－ジメチル－２－プロペニル、１，２－ジメチル－１－プロペニル、１，２－ジメチル－２－プロペニル、１－エチル－１－プロペニル、１－エチル－２－プロペニル、１－ヘキセニル、２－ヘキセニル、３－ヘキセニル、４－ヘキセニル、５－ヘキセニル、１－メチル－１－ペンテニル、２－メチル－１－ペンテニル、３－メチル－１－ペンテニル、４－メチル－１－ペンテニル、１－メチル－２－ペンテニル、２－メチル－２－ペンテニル、３－メチル－２－ペンテニル、４－メチル－２－ペンテニル、１－メチル－３－ペンテニル、２－メチル－３－ペンテニル、３－メチル－３－ペンテニル、４－メチル－３－ペンテニル、１－メチル－４－ペンテニル、２－メチル－４－ペンテニル、３－メチル－４－ペンテニル、４－メチル－４－ペンテニル、１，１－ジメチル－２－ブテニル、１，１－ジメチル－３－ブテニル、１，２－ジメチル－１－ブテニル、１，２－ジメチル－２－ブテニル、１，２－ジメチル－３－ブテニル、１，３－ジメチル－１－ブテニル、１，３－ジメチル－２－ブテニル、１，３－ジメチル－３－ブテニル、２，２－ジメチル－３－ブテニル、２，３－ジメチル－１－ブテニル、２，３－ジメチル－２－ブテニル、２，３－ジメチル－３－ブテニル、３，３－ジメチル－１－ブテニル、３，３－ジメチル－２－ブテニル、１－エチル－１－ブテニル、１－エチル－２－ブテニル、１－エチル－３－ブテニル、２－エチル－１－ブテニル、

２－エチル－２－ブテニル、２－エチル－３－ブテニル、１，１，２－トリメチル－２－プロペニル、１－エチル－１－メチル－２－プロペニル、１－エチル－２－メチル－１－プロペニル、及び、１－エチル－２－メチル－２－プロペニル；

シクロアルキル：　３～８個の炭素環員を有する単環式飽和ヒドロカルビル基、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、及び、シクロオクチル；

アリール：　置換されていないか又は置換されている芳香族の単環式環、二環式環又は三環式環、例えば、フェニル、ナフチル、アントラセニル（アントリル）、フェナントラセニル（フェナントリル）；

ヘタリール：　最大で４個までの窒素原子を含んでいるか又は１個の窒素原子とＮ、Ｏ及びＳから選択される最大で２個までのさらなるヘテロ原子とを含んでいる、置換されていないか又は置換されている５～７員の不飽和ヘテロ環式環：例えば、２－フリル、３－フリル、２－チエニル、３－チエニル、２－ピロリル、３－ピロリル、１－ピロリル、３－ピラゾリル、４－ピラゾリル、５－ピラゾリル、１－ピラゾリル、１Ｈ－イミダゾール－２－イル、１Ｈ－イミダゾール－４－イル、１Ｈ－イミダゾール－５－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、２－オキサゾリル、４－オキサゾリル、５－オキサゾリル、２－チアゾリル、４－チアゾリル、５－チアゾリル、３－イソオキサゾリル、４－イソオキサゾリル、５－イソオキサゾリル、３－イソチアゾリル、４－イソチアゾリル、５－イソチアゾリル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－５－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－イル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル、４Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル、４Ｈ－１，２，４－トリアゾール－４－イル、１Ｈ－テトラゾール－１－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、２Ｈ－テトラゾール－２－イル、２Ｈ－テトラゾール－５－イル、１，２，４－オキサジアゾール－３－イル、１，２，４－オキサジアゾール－５－イル、１，２，４－チアジアゾール－３－イル、１，２，４－チアジアゾール－５－イル、１，３，４－オキサジアゾール－２－イル、１，３，４－チアジアゾール－２－イル、１，２，３－オキサジアゾール－４－イル、１，２，３－オキサジアゾール－５－イル、１，２，３－チアジアゾール－４－イル、１，２，３－チアジアゾール－５－イル、１，２，５－オキサジアゾール－３－イル、１，２，５－チアジアゾール－３－イル、２－ピリジニル、３－ピリジニル、４－ピリジニル、３－ピリダジニル、４－ピリダジニル、２－ピリミジニル、４－ピリミジニル、５－ピリミジニル、２－ピラジニル、１，３，５－トリアジン－２－イル、１，２，４－トリアジン－３－イル、１，２，４－トリアジン－５－イル、１，２，４－トリアジン－６－イル。

【００５４】

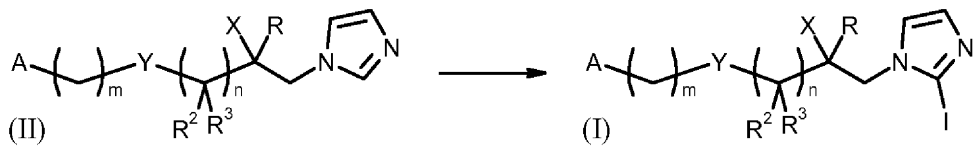
調製方法及び中間体についての説明

式（Ｉ）で表される２－ヨードイミダゾール誘導体は、種々の方法で調製することができる。初めに、可能な調製方法について以下に図式的に示す。特に別途示されていない限り、ラジカルは、それぞれ、上記で定義されているとおりである。

【００５５】

【化２】

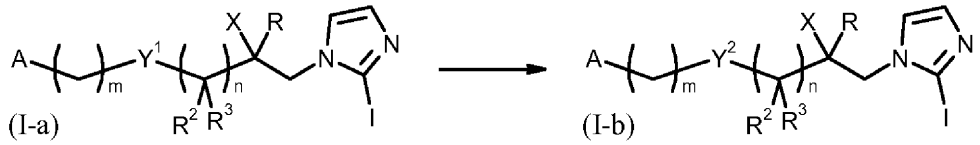
スキーム１：調製方法Ａ



【００５６】

【化３】

スキーム２：調製方法Ｂ



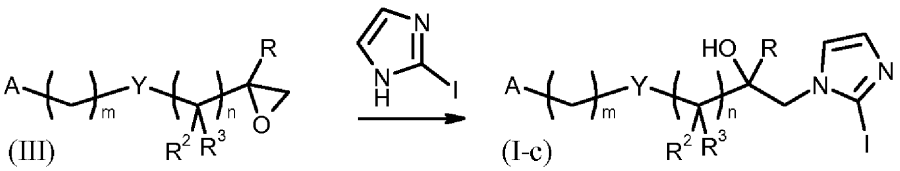
Y^1 は、Ｓを表す。

Y^2 は、ＳＯ又はＳＯ$_2$を表す。

【００５７】

【化４】

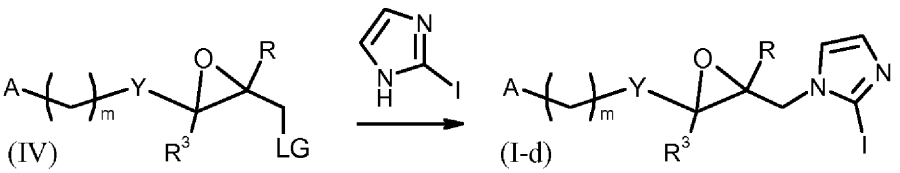
スキーム３：調製方法Ｃ



【００５８】

【化５】

スキーム４：調製方法Ｄ



ＬＧは、求核的に置換可能な脱離基、例えば、塩素、臭素、ヨウ素、
メタンスルホニルオキシ又は４－メチルフェニルスルホニルオキシを表す。

上記及び下記の式及び化学反応式に関するラジカルの好ましい定義は、上記で既に与えられている。これらの定義は、式（Ｉ）で表される最終生成物に対してのみ適用されるのではなく、全ての中間体に対して同様に適用される。

【００５９】

調製方法Ａ

本発明に従う調製方法Ａを実施するときに出発物質として必要とされる式（ＩＩ）で表されるイミダゾール誘導体は、既知であり、且つ、既知方法で調製することができる（ｃｆ．　ＥＰ－Ａ　００４０３４５、ＥＰ－Ａ　０７９３６５７、ＥＰ－Ａ　０２９７３４５、ＥＰ－Ａ　０４２１１２５、ＥＰ－Ａ　０３８６５５７、ＥＰ－Ａ　０３７８９５３）。

【００６０】

本発明に従う調製方法Ａの実施において同様に必要とされるヨウ素化剤は、既知である。可能な例としては、以下のものを挙げることができる：元素ヨウ素又は一塩化ヨウ素、Ｎ－ヨードアセトアミド、Ｎ－ヨードスクシンイミド。

【００６１】

本発明に従う調製方法Ａは、塩基の存在下で実施する。この目的に適しているものは、慣習的な無機塩基又は有機塩基、好ましくは、アルカリ金属水素化物、例えば、水素化ナ

トリウム若しくは水素化カリウム、アミド類、例えば、ナトリウムアミド、ナトリウムビス（トリメチルシリル）アミド（Ｎａ－ＨＤＭＳ）、リチウムビス（トリメチルシリル）アミド（Ｌｉ－ＨＤＭＳ）、リチウムジイソプロピルアミド（ＬＤＡ）若しくはリチウムテトラメチルピペリジド（ＬｉＴＭＰ）、又は、有機金属化合物、例えば、ｎ－ブチルリチウム、ｓｅｃ－ブチルリチウム若しくはｔｅｒｔ－ブチルリチウム（ｎ－ＢｕＬｉ、ｓｅｃ－ＢｕＬｉ、ｔｅｒｔ－ＢｕＬｉ）、又は、フェニルリチウムなどである。

【００６２】

本発明に従う調製方法Ａは、通常、希釈剤の存在下、－７８℃～＋１００℃の温度で実施する。

【００６３】

適切な希釈剤は、好ましくは、エーテル類、例えば、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、１，２－ジメトキシエタン、グリコールジメチルエーテル若しくはジエチレングリコールジメチルエーテル、又は、炭化水素類、例えば、ベンゼン、キシレン若しくはトルエンなどである。

【００６４】

本発明に従う当該反応は、好ましくは、不活性ガス下、例えば、特に、窒素下又はアルゴン下で実施する。

【００６５】

調製方法Ｂ

上記調製方法で調製可能な式（Ｉ－ａ）で表される化合物は、一般構造（Ｉ－ｂ）を有する目的化合物にさらに変換することができる。

【００６６】

（Ｉ－ａ）の変換に関しては、酸化剤、特に、過酸化物又は過酸（例えば、過酸化水素、又は、メタ－クロロ過安息香酸）を使用することができる。

【００６７】

本発明に従う調製方法Ｂは、典型的には、希釈剤（例えば、ジクロロメタン）の存在下、－２０℃～＋１００℃の温度で実施する。

【００６８】

調製方法Ｃ

本発明に従う調製方法Ｃを実施するのに出発物質として必要とされる、式（ＩＩＩ）で表されるエポキシド誘導体は、既知であり、且つ、既知方法で調製することができる（例えば、ＤＥ－Ａ　４０２７６０８、ＤＥ－Ａ　３５３７８１７）。

【００６９】

本発明に従う調製方法Ｃを実施するのに同様に必要とされる２－ヨード－１Ｈ－イミダゾールは、市販されているか、又は、市販されている前駆物質から文献に記載されている方法によって調製することができる（Ｍｏｌｅｃｕｌｅｓ　２００５，　１０，　４０１－４０６）。

【００７０】

本発明に従う調製方法Ｃは、塩基の存在下で実施する。この目的に適しているものは、慣習的な無機塩基又は有機塩基、好ましくは、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、炭酸塩、重炭酸塩、水素化物、水酸化物又はアルコキシド、例えば、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム若しくは酢酸カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸カルシウム若しくは炭酸セシウム、重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウム若しくは重炭酸カルシウム、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム若しくは水素化カルシウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム若しくは水酸化カルシウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、ナトリウムｎ－プロポキシド、ナトリウムイソプロポキシド、ナトリウムｎ－ブトキシド、ナトリウムイソブトキシド、ナトリウムｓｅｃ－ブトキシド若しくはナトリウムｔｅｒｔ－ブトキシド、又は、カリウムメトキシド、カリウムエトキシド、カリウムｎ－プロポキシド、カリウムイソプロポキシド、カリウムｎ－ブトキシド、カリウムイソブトキシド、カリウムｓｅｃ－ブトキシド若しくはカリウムｔ

ｅｒｔ－ブトキシドなどである。

【００７１】

本発明に従う調製方法Ｃは、通常、希釈剤の存在下、－７８℃～＋１００℃の温度で実施する。好ましい希釈剤は、以下のものである：アミド類、例えば、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド及びＮ－メチルピロリドン、並びに、さらに、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホン及びヘキサメチルリン酸トリアミド及びＤＭＰＵ；ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソプロピルケトン又はメチルイソブチルケトン。本発明に従う当該反応は、好ましくは、不活性ガス下、例えば、特に、窒素下又はアルゴン下で、実施する。

【００７２】

調製方法Ｄ

本発明に従う調製方法Ｄを実施するのに出発物質として必要とされる、式（ＩＶ）で表されるエポキシド誘導体は、既知であり、且つ、既知方法で調製することができる（例えば、ＥＰ－Ａ　０４２１１２５、ＥＰ－Ａ　０３８６５５７）。

【００７３】

本発明に従う調製方法Ｄを実施するのに同様に必要とされる２－ヨード－１Ｈ－イミダゾールは、市販されているか、又は、市販されている前駆物質から文献に記載されている方法によって調製することができる（Ｍｏｌｅｃｕｌｅｓ　２００５，　１０，　４０１－４０６）。

【００７４】

本発明に従う調製方法Ｄは、塩基の存在下で実施する。この目的に適しているものは、慣習的な無機塩基又は有機塩基、好ましくは、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、炭酸塩、重炭酸塩、水素化物、水酸化物又はアルコキシド、例えば、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム若しくは酢酸カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸カルシウム若しくは炭酸セシウム、重炭酸ナトリウム、重炭酸カリウム若しくは重炭酸カルシウム、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム若しくは水素化カルシウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム若しくは水酸化カルシウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、ナトリウムｎ－プロポキシド、ナトリウムイソプロポキシド、ナトリウムｎ－ブトキシド、ナトリウムイソブトキシド、ナトリウムｓｅｃ－ブトキシド若しくはナトリウムｔｅｒｔ－ブトキシド、又は、カリウムメトキシド、カリウムエトキシド、カリウムｎ－プロポキシド、カリウムイソプロポキシド、カリウムｎ－ブトキシド、カリウムイソブトキシド、カリウムｓｅｃ－ブトキシド若しくはカリウムｔｅｒｔ－ブトキシドなどである。ピリジン又は４－ジメチルアミノピリジン、アルカリ金属アミド類（例えば、ナトリウムアミド及びカリウムアミド）を使用するのも好ましい。

【００７５】

好ましい反応促進剤は、金属ハロゲン化物、例えば、ヨウ化ナトリウム若しくはヨウ化カリウム、第４級アンモニウム塩、例えば、塩化テトラブチルアンモニウム、臭化テトラブチルアンモニウム、ヨウ化テトラブチルアンモニウム、重硫酸テトラブチルアンモニウム、塩化ベンジルトリエチルアンモニウム若しくは臭化ベンジルトリエチルアンモニウム、又は、クラウンエーテル類、例えば、１２－クラウン－４、１５－クラウン－５、１８－クラウン－６、ジベンゾ－１８－クラウン－６若しくはジシクロヘキサノ－１８－クラウン－６である。

【００７６】

本発明に従う調製方法Ｄは、通常、希釈剤の存在下、－７８℃～＋１００℃の温度で実施する。好ましい希釈剤は、以下のものである：アミド類、例えば、ジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ジエチルアセトアミド及びＮ－メチルピロリドン、並びに、さらに、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホン及びヘキサメチルリン酸トリアミド及びＤＭＰＵ。本発明に従う当該反応は、好ましくは、不活性ガス下、例えば、特に、窒素下又はアルゴン下で実施する。

【００７７】

本発明に従う一般式（Ｉ）で表される２－ヨードイミダゾール誘導体は、酸付加塩又は金属塩錯体に変換することができる。

【００７８】

一般式（Ｉ）で表される化合物の生理学的に許容される酸付加塩を製造するのに適しているものは、好ましくは、以下の酸である：ハロゲン化水素酸、例えば、塩酸及び臭化水素酸、特に、塩酸、並びに、さらに、リン酸、硝酸、硫酸、単官能性及び二官能性のカルボン酸及びヒドロキシカルボン酸（ｈｙｄｒｏｘｙｃａｒｂｏｙｌｉｃ　ａｃｉｄｓ）、例えば、酢酸、マレイン酸、コハク酸、フマル酸、酒石酸、クエン酸、サリチル酸、ソルビン酸、乳酸、並びに、スルホン酸、例えば、ｐ－トルエンスルホン酸及び１，５－ナフタレンジスルホン酸。

【００７９】

一般式（Ｉ）で表される化合物の酸付加塩は、塩を形成させるための慣習的な方法によって、例えば、一般式（Ｉ）で表される化合物を適切な不活性溶媒に溶解させ及び当該酸（例えば、塩酸）を添加することによって、容易に得ることが可能であり、並びに、既知方法で、例えば、それらを濾過することによって、単離することが可能であり、並びに、場合により、不活性有機溶媒で洗浄することによって精製することが可能である。

【００８０】

一般式（Ｉ）で表される化合物の金属塩錯体を調製するために、好ましい選択肢は、周期表の第ＩＩ主族～第ＩＶ主族の金属並びに第Ｉ遷移族及び第ＩＩ遷移族及び第ＩＶ遷移族～第ＶＩＩＩ遷移族の金属（その例としては、銅、亜鉛、マンガン、マグネシウム、スズ、鉄及びニッケルなどを挙げることができる）の塩である。

【００８１】

当該塩の有用なアニオンとしては、好ましくは、以下の酸から誘導されるアニオンなどを挙げることができる：　ハロゲン化水素酸、例えば、塩酸及び臭化水素酸、並びに、さらに、リン酸、硝酸及び硫酸。

【００８２】

一般式（Ｉ）で表される化合物の金属塩錯体は、慣習的な方法によって、例えば、当該金属塩をアルコール（例えば、エタノール）に溶解させ、且つ、一般式（Ｉ）で表される化合物の溶液を添加することによって、容易に得ることができる。金属塩錯体は、既知方法で、例えば、濾過することによって単離することが可能であり、及び、場合により、再結晶させることによって、精製することが可能である。

【００８３】

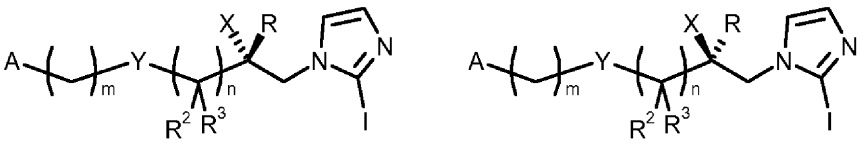
本発明に従って使用することが可能な２－ヨードイミダゾール誘導体は、場合により、種々の可能な異性体形態の混合物として、特に、立体異性体（例えば、Ｅ及びＺ異性体、トレオ及びエリトロ異性体）の混合物として、及び、光学異性体の混合物として存在することができ、適切な場合には、さらに、互変異性体の混合物としても存在することができる。特許請求されているのは、Ｅ異性体とＺ異性体、及び、さらに、トレオとエリトロ、及び、さらに、光学異性体、これら異性体の任意の混合物、及び、さらに、可能な互変異性体形態である。

【００８４】

適切な場合には、式（Ｉ）で表される化合物は、特に、エナンチオマー：

【００８５】

【化６】



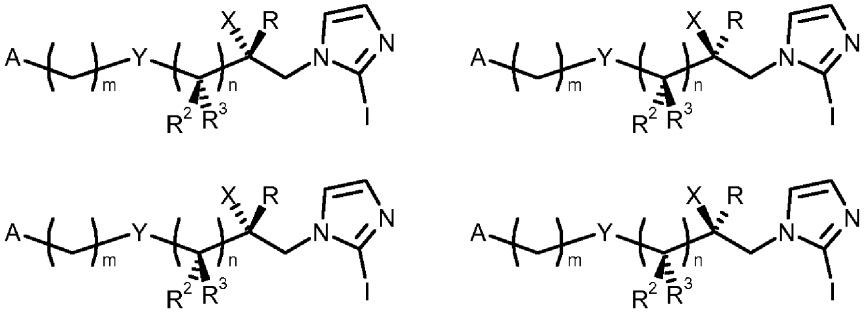
の形態で存在している。

【００８６】

置換基Ｒ^{2}と置換基Ｒ^{3}とが異なっている場合、以下のジアステレオマーが、場合により、様々な混合物で存在している：

【００８７】

【化７】



本発明は、さらに、本発明に従う活性化合物を含んでいる、望ましくない微生物（特に、望ましくない菌類）を防除するための作物保護組成物にも関する。前記組成物は、好ましくは、農業において適切な補助剤、溶媒、担体、界面活性剤又は増量剤を含んでいる殺菌剤組成物である。

【００８８】

さらに、本発明は、望ましくない微生物を防除する方法にも関し、ここで、該方法は、本発明に従う活性化合物を当該植物病原性菌類及び／又はそれらの生息環境に施用することを特徴とする。

【００８９】

本発明によれば、担体は、特に植物若しくは植物の部分又は種子への施用に関して、適用性を良好にするために、当該活性化合物と混合させるか又は結合させる、天然若しくは合成の有機物質又は無機物質である。当該担体は、固体又は液体であってよいが、一般に、不活性であり、且つ、農業において使用するのに適しているべきである。

【００９０】

有用な固体又は液体の担体としては、以下のものが挙げられる：例えば、アンモニウム塩、並びに、天然岩粉、例えば、カオリン、クレー、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイト又はケイ藻土、並びに、合成岩粉、例えば、微粉化シリカ、アルミナ及び天然又は合成のシリケート、樹脂、蝋、固形肥料、水、アルコール、特に、ブタノール、有機溶媒、鉱油及び植物油、並びに、それらの誘導体。かかる担体の混合物も同様に使用し得る。粒剤に有用な固体担体としては、以下のものが挙げられる：例えば、粉砕して分別した天然石、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石、苦灰岩、並びに、無機及び有機の粗挽き粉からなる合成顆粒、並びに、さらに、有機材料、例えば、おがくず、ココナッツ殻、トウモロコシ穂軸及びタバコの葉柄などからなる顆粒。

【００９１】

有用な液化ガス増量剤又は担体は、標準温度及び標準圧力下では気体である液体、例えば、エーロゾル噴射剤、例えば、ハロ炭化水素類、さらに、ブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素などである。

【００９２】

当該製剤において、粘着付与剤、例えば、カルボキシメチルセルロース、並びに、粉末、顆粒又はラテックスの形態にある天然ポリマー及び合成ポリマー、例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニル、又は、天然のリン脂質、例えば、セファリン及びレシチン、及び、合成リン脂質などを使用することができる。さらなる添加剤は、鉱油及び植物油であり得る。

【００９３】

使用する増量剤が水である場合、例えば、有機溶媒を補助溶媒として使用することもできる。有用な液体溶媒は、本質的に、以下のものである：芳香族化合物、例えば、キシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族化合物及び塩素化脂肪族炭化水素

、例えば、クロロベンゼン類、クロロエチレン類又はジクロロメタン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサン又はパラフィン類、例えば、鉱油留分、鉱油及び植物油、アルコール類、例えば、ブタノール又はグリコールとそれらのエーテル及びエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えば、ジメチルホルムアミド及びジメチルスルホキシド、及び、さらに、水。

【００９４】

本発明に従う組成物には、付加的な更なる成分（例えば、界面活性剤など）も含有させることができる。適切な界面活性剤は、イオン特性若しくは非イオン特性を有する乳化剤及び／又は泡形成剤、分散剤若しくは湿潤剤であるか、或いは、そのような界面活性剤の混合物である。これらの例は、以下のものである：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若しくはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールの重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪酸の重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪アミンの重縮合物、置換されているフェノール（好ましくは、アルキルフェノール又はアリールフェノール）、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、アルキルタウレート）、ポリエトキシ化アルコールのリン酸エステル若しくはポリエトキシ化フェノールのリン酸エステル、ポリオールの脂肪酸エステル、並びに、スルフェート、スルホネート及びホルフェート塩を含んでいる該化合物の誘導体、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリールスルホネート類、タンパク質加水分解物、リグノスルファイト廃液及びメチルセルロースなど。該活性化合物のうちの１種類及び／又は該不活性担体のうちの１種類が水不溶性であり、且つ、施用が水で行われる場合は、界面活性剤を存在させることが必要である。界面活性剤の割合は、本発明に従う組成物の５重量％～４０重量％である。

【００９５】

着色剤、例えば、無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタン及びプルシアンブルー（Ｐｒｕｓｓｉａｎ　Ｂｌｕｅ）、並びに、有機染料、例えば、アリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、並びに、微量栄養素、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などを使用することができる。

【００９６】

適切な場合には、付加的な別の成分、例えば、保護コロイド、結合剤、粘着剤、増粘剤、揺変性物質、浸透剤、安定化剤、金属イオン封鎖剤、錯化剤なども存在させることができる。一般的に、該活性化合物は、製剤目的で慣習的に使用される固体又は液体の任意の添加剤と組み合わせることが可能である。

【００９７】

本発明に従う組成物及び製剤は、一般に、０．０５～９９重量％、０．０１～９８％重量％、好ましくは、０．１～９５重量％、特に好ましくは、０．５～９０重量％の活性化合物を含有し、極めて特に好ましくは、１０～７０重量％の活性化合物を含有する。

【００９８】

本発明に従う活性化合物又は組成物は、そのままで使用することが可能であるか、或いは、それらの個々の物理的及び／又は化学的特性に応じて、以下のようなそれらの製剤の形態若しくはその製剤から調製される使用形態で使用することが可能である：例えば、エーロゾル、カプセル懸濁液剤、冷煙霧濃厚剤（ｃｏｌｄ－ｆｏｇｇｉｎｇ　ｃｏｎｃｅｎｔｒａｔｅ）、温煙霧濃厚剤（ｗａｒｍ－ｆｏｇｇｉｎｇ　ｃｏｎｃｅｎｔｒａｔｅ）、カプセル化粒剤、細粒剤、種子処理用フロアブル剤、即時使用可能な溶液剤（ｒｅａｄｙ－ｔｏ－ｕｓｅ　ｓｏｌｕｔｉｏｎ）、散粉性粉剤、乳剤、水中油型エマルション剤、油中水型エマルション剤、大型粒剤、微粒剤、油分散性粉末剤、油混和性フロアブル剤、油混和性液剤、泡剤（ｆｏａｍ）、ペースト剤、農薬粉衣種子、懸濁製剤（ｓｕｓｐｅｎｓｉｏｎ　ｃｏｎｃｅｎｔｒａｔｅ）、サスポエマルション製剤、可溶性濃厚剤（ｓｏｌｕｂｌｅ　ｃｏｎｃｅｎｔｒａｔｅ）、懸濁液剤（ｓｕｓｐｅｎｓｉｏｎ）、水和剤、可溶

性粉末剤（ｓｏｌｕｂｌｅ　ｐｏｗｄｅｒ）、粉剤及び粒剤、水溶性顆粒剤又は錠剤、種子処理用水溶性粉末剤、水和剤、活性化合物が含浸されている天然生成物及び合成物質、並びに、さらに、ポリマー物質中にマイクロカプセル化されているもの及び種子用のコーティング物質中にマイクロカプセル化されているもの、並びに、さらに、ＵＬＶ冷煙霧製剤（ＵＬＶ　ｃｏｌｄ－ｆｏｇｇｉｎｇ　ｆｏｒｍｕｌａｔｉｏｎ）及びＵＬＶ温煙霧製剤（ＵＬＶ　ｗａｒｍ－ｆｏｇｇｉｎｇ　ｆｏｒｍｕｌａｔｉｏｎ）。

【００９９】

当該製剤は、それ自体公知の方法で、例えば、当該活性化合物を少なくとも１種類の慣習的な増量剤、溶媒又は希釈剤、乳化剤、分散剤及び／又は結合剤又は固着剤、湿潤剤、撥水剤、適切な場合には、乾燥剤及び紫外線安定剤、並びに、適切な場合には、染料及び顔料、消泡剤、防腐剤、第２の増粘剤、粘着剤、ジベレリン類、並びに、さらに、さらなる加工助剤と混合させることによって、調製することができる。

【０１００】

本発明に従う組成物には、既に使用し得る状態にあって適切な装置を用いて植物又は種子に対して施用可能な製剤のみではなく、使用前に水で希釈することが必要な商業的な濃縮物も包含される。

【０１０１】

本発明に従う活性化合物は、それだけで存在し得るか、又は、その（商業用）製剤中に、及び、そのような製剤から調製された使用形態中に、殺虫剤、誘引剤、不妊剤、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、薬害軽減剤及び／又は情報化学物質などの別の（既知）活性化合物との混合物として、存在し得る。

【０１０２】

上記活性化合物又は組成物を用いた植物及び植物の部分の、本発明に従う処理は、慣習的な処理方法を使用して、例えば、浸漬、散布、噴霧、灌漑、気化、散粉、煙霧、ばらまき、泡状化、塗布、拡散（ｓｐｒｅａｄｉｎｇ－ｏｎ）、灌水（灌注（ｄｒｅｎｃｈｉｎｇ））、点滴潅漑などによって、直接的に行うか、又は、該活性化合物又は組成物を植物及び植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることにより行い、また、繁殖器官（ｐｒｏｐａｇａｔｉｏｎ　ｍａｔｅｒｉａｌ）の場合、特に種子の場合には、さらに、例えば、乾式種子処理用の粉末、種子処理用の溶液、スラリー処理用の水溶性粉末として、被覆することによって、１層以上の被膜をコーティングすること等によって行う。さらに、該活性化合物を微量散布法（ｕｌｔｒａ－ｌｏｗ　ｖｏｌｕｍｅ　ｍｅｔｈｏｄ）によって施用することも可能であり、又は、該活性化合物調製物若しくは該活性化合物自体を土壌中に注入することも可能である。

【０１０３】

本発明は、さらに、種子の処理方法も包含する。

【０１０４】

本発明は、さらに、前の段落において記述されている方法のうちの１つによって処理された種子にも関する。本発明に従う種子は、望ましくない微生物から種子を保護するための方法において使用される。これらの方法においては、本発明に従う少なくとも１種類の活性化合物で処理された種子を使用する。

【０１０５】

本発明に従う活性化合物又は組成物は、種子を処理するのにも適している。有害な生物に起因する作物植物に対する被害の大部分は、貯蔵中に、又は、播種後、植物が発芽している最中及び発芽の後に、種子が感染することによって引き起こされる。この相は特に危険である。それは、生長している植物の根及び苗条は特に感受性が高く、ささいな損傷であってもその植物が死に至り得るからである。従って、適切な組成物を用いて種子及び発芽中の植物を保護することに、大きな関心が持たれている。

【０１０６】

植物の種子を処理することによる植物病原性菌類の防除は、長い間知られており、継続的に改良が加えられている。しかしながら、種子の処理には、必ずしも満足のいくように

解決することができるわけではない一連の問題を伴う。例えば、播種後又は植物の出芽後に作物保護組成物を追加で施用（ｄｅｐｌｏｙｍｅｎｔ）することを不要とするか又は少なくとも著しく低減させるような、種子及び発芽中の植物を保護する方法を開発することは望ましい。さらに、使用する活性化合物によって植物自体に損傷を与えることなく、植物病原性菌類による攻撃から種子及び発芽中の植物が最適に保護され得るように、使用する活性化合物の量を最適化することも望ましい。特に、種子を処理する方法では、最少量の作物保護剤を使用して種子及び発芽中の植物の最適な保護を達成するために、トランスジェニック植物の内因性の殺菌特性も考慮に入れるべきである。

【０１０７】

従って、本発明は、植物病原性菌類による攻撃から種子及び発芽中の植物を保護する方法にも関し、ここで、該方法は、当該種子を本発明の組成物で処理することによる。本発明は、さらに、種子及び発芽中の植物を植物病原性菌類から保護するために種子を処理するための本発明の組成物の使用にも関する。さらに、本発明は、植物病原性菌類から保護されるように、本発明の組成物で処理された種子にも関する。

【０１０８】

出芽後の植物に損傷を与える植物病原性菌類の防除は、主として、土壌及び植物の地上部を作物保護組成物で処理することによって行われる。作物保護剤は、環境並びにヒト及び動物の健康に対して影響を及ぼし得ることに関して懸念があるので、施用する活性化合物の量を低減する努力が成されている。

【０１０９】

本発明の有利な点の１つは、本発明の活性化合物及び組成物が有している際立った浸透移行特性によって、その活性化合物及び組成物で種子を処理することにより、植物病原性菌類から、その種子自体が保護されるのみではなく、出芽後に生じる植物も保護されるということである。このようにして、播種時又は播種後間もなくの作物の即時的な処理を省くことができる。

【０１１０】

さらにまた、本発明に従う活性化合物又は組成物が、特に、トランスジェニック種子（ここで、その種子から成長した植物は、有害生物に対して作用するタンパク質を発現することができる）に対しても使用することが可能であるということも、有利な点として見なされる。かかる種子を本発明の活性化合物又は組成物で処理することで、単にタンパク質（例えば、殺虫性タンパク質）が発現することによって、特定の有害生物を防除可能である。驚くべきことに、この場合、さらなる相乗効果が観察されることがあり得る。そのような相乗効果は、有害生物による攻撃に対する保護の有効性をさらに増大させる。

【０１１１】

本発明に従う組成物は、農業において、温室内で、森林で又は園芸及びブドウ栽培において使用されるいずれ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、禾穀類（例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、ライコムギ、ソルガム／アワ、及び、エンバク）、トウモロコシ、ワタ、ダイズ、イネ、ジャガイモ、ヒマワリ、インゲンマメ、コーヒー、ビート（例えば、テンサイ、及び、飼料用ビート）、ラッカセイ、ナタネ、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、及び、レタス）、芝生及び観賞植物の種子である（下記も参照されたい）。禾穀類（例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、ライコムギ、及び、エンバク）、トウモロコシ及びイネの種子を処理することは、特に重要である。

【０１１２】

以下でもさらに記載されているように、本発明の活性化合物又は組成物によるトランスジェニック種子の処理は、特に重要である。このことは、殺虫特性を有するポリペプチド又はタンパク質の発現を可能にする少なくとも１種類の異種遺伝子を含んでいる植物の種子に関連する。トランスジェニック種子内の異種遺伝子は、例えば、バシルス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ）種、リゾビウム（Ｒｈｉｚｏｂｉｕｍ）種、シュードモナス（Ｐｓｅｕｄｏｍｏｎａｓ）種、セラチア（Ｓｅｒｒａｔｉａ）種、トリコデルマ（Ｔｒｉｃｈｏｄｅｒｍ

ａ）種、クラビバクテル（Ｃｌａｖｉｂａｃｔｅｒ）種、グロムス（Ｇｌｏｍｕｓ）種又はグリオクラジウム（Ｇｌｉｏｃｌａｄｉｕｍ）種の微生物に由来し得る。この異種遺伝子は、好ましくは、バシルス属種（Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｓｐ．）に由来し、この場合、その遺伝子産物は、アワノメイガ（Ｅｕｒｏｐｅａｎ　ｃｏｒｎ　ｂｏｒｅｒ）及び／又はウェスタンメイズルートワーム（Ｗｅｓｔｅｒｎ　ｃｏｒｎ　ｒｏｏｔｗｏｒｍ）に対して有効である。特に好ましくは、該異種遺伝子は、バシルス・ツリンギエンシス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓ）に由来する。

【０１１３】

本発明に関連して、本発明に従う組成物は、種子に対して、単独で施用するか、又は、適切な製剤中に含ませて施用する。好ましくは、種子は、処理の過程で損傷が起こらないように、充分に安定な状態で処理する。一般に、種子は、収穫と播種の間の任意の時点で処理することができる。慣習的には、植物から分離されており、且つ、穂軸、殻、葉柄、外皮、被毛又は果肉を伴っていない種子を使用する。例えば、収穫され、不純物が取り除かれ、含水量が１５重量％未満となるまで乾燥された種子を使用することができる。あるいは、乾燥後に例えば水で処理され、その後再度乾燥された種子を使用することもできる。

【０１１４】

種子を処理する場合、種子の発芽が悪影響を受けないように、又は、種子から生じた植物が損傷を受けないように、種子に施用する本発明組成物の量及び／又はさらなる添加剤の量を選択することに関して一般に注意しなくてはならない。このことは、とりわけ、特定の施用量で薬害作用を示し得る活性化合物の場合には、留意しなくてはならない。

【０１１５】

本発明の組成物は、直接的に施用することが、即ち、別の成分を含ませることなく、また、希釈することなく、施用することが可能である。一般に、該組成物は、適切な製剤の形態で種子に施用するのが好ましい。種子を処理するための適切な製剤及び方法は、当業者には知られており、例えば、以下の文献に記載されている：ＵＳ　４，２７２，４１７、ＵＳ　４，２４５，４３２、ＵＳ　４，８０８，４３０、ＵＳ　５，８７６，７３９、ＵＳ　２００３／０１７６４２８Ａ１、ＷＯ　２００２／０８０６７５、ＷＯ　２００２／０２８１８６。

【０１１６】

本発明に従って使用することが可能な活性化合物は、慣習的な種子粉衣製剤、例えば、溶液剤、エマルション剤、懸濁液剤、粉末剤、泡剤、スラリー剤又は種子用の別のコーティング組成物や、及び、さらに、ＵＬＶ製剤などに変換することができる。

【０１１７】

これらの製剤は、既知方法で、活性化合物を、慣習的な添加剤、例えば、慣習的な増量剤、及び、さらに、溶媒又は希釈剤、着色剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、防腐剤、第２の増粘剤、粘着剤、ジベレリン類などと混合させ、且つ、さらに、水と混合させることによって、調製する。

【０１１８】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤中に存在させることができる有用な着色剤は、そのような目的に関して慣習的な全ての着色剤がである。水中であまり溶解しない顔料又は水中で溶解する染料のいずれかを使用することができる。その例としては、「Ｒｈｏｄａｍｉｎ　Ｂ」、「Ｃ．Ｉ．Ｐｉｇｍｅｎｔ　Ｒｅｄ　１１２」及び「Ｃ．Ｉ．Ｓｏｌｖｅｎｔ　Ｒｅｄ　１」の名称で知られている染料などを挙げることができる。

【０１１９】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤中に存在させることができる適切な湿潤剤は、農薬活性化合物の製剤に関して慣習的に使用される、湿潤を促進する全ての物質である。好ましくは、アルキルナフタレンスルホネート類、例えば、ジイソプロピルナフタレンスルホネート又はジイソブチルナフタレンスルホネートなどを使用する。

【０１２０】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤中に存在させることができる適切な分散剤及び／又は乳化剤は、農薬活性化合物の製剤に慣習的に使用される非イオン性、アニオン性及びカチオン性の全ての分散剤である。好ましくは、非イオン性若しくはアニオン性の分散剤又は非イオン性若しくはアニオン性の分散剤の混合物を使用することができる。挙げることができる適切な非イオン性分散剤は、特に、エチレンオキシド／プロピレンオキシドブロックポリマー類、アルキルフェノールポリグリコールエーテル類及びトリスチリルフェノールポリグリコールエーテル類、並びに、それらのリン酸化誘導体又は硫酸化誘導体である。適切なアニオン性分散剤は、特に、リグノスルホネート類、ポリアクリル酸塩類及びアリールスルホネート／ホルムアルデヒド縮合物である。

【０１２１】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤中に存在させることができる消泡剤は、農薬活性化合物の製剤中に慣習的に使用される全ての泡抑制物質である。好ましくは、シリコーン消泡剤及びステアリン酸マグネシウムを使用することができる。

【０１２２】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤中に存在させることができる防腐剤は、農薬組成物中でかかる目的のために使用することが可能な全ての物質がである。例として、ジクロロフェン及びベンジルアルコールヘミホルマールなどを挙げることができる。

【０１２３】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤中に存在させることができる第２の増粘剤は、農薬組成物中でかかる目的のために使用することが可能な全ての物質である。セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサンタン、変性クレー及び微粉化シリカが好ましい。

【０１２４】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤中に存在させることができる粘着剤は、種子粉衣製品中で使用可能な全ての慣習的な結合剤である。ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール及びチロースを好ましいものとして挙げることができる。

【０１２５】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤中に存在させることができるジベレリンは、好ましくは、ジベレリンＡ１、ジベレリンＡ３（＝ジベレリン酸）、ジベレリンＡ４及びジベレリンＡ７である。特に好ましくは、ジベレリン酸を使用する。当該ジベレリン類は既知である（ｃｆ．Ｒ．Ｗｅｇｌｅｒ“Ｃｈｅｍｉｅ ｄｅｒ Ｐｆｌａｎｚｅｎｓｃｈｕｔｚ－ ｕｎｄ Ｓｃｈａｄｌｉｎｇｓｂｅｋａｍｐｆｕｎｇｓｍｉｔｔｅｌ”［Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ ｏｆ ｔｈｅ Ｃｒｏｐ Ｐｒｏｔｅｃｔｉｏｎ Ｃｏｍｐｏｓｉｔｉｏｎｓ ａｎｄ Ｐｅｓｔｉｃｉｄｅｓ］，ｖｏｌ．２，Ｓｐｒｉｎｇｅｒ Ｖｅｒｌａｇ，１９７０，ｐ．４０１－４１２）。

【０１２６】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤は、広い範囲の種子（これは、トランスジェニック植物の種子を包含する）を処理するために、直接的に使用することができるか、又は、予め水で希釈したあとで使用することができる。これに関連して、発現により形成された物質と協力して、付加的な相乗効果が生じることもあり得る。

【０１２７】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤又は水を添加することによってその種子粉衣製剤から調製された調製物で種子を処理するためには、種子粉衣操作に関して慣習的に使用可能な全ての混合機が適している。具体的には、種子粉衣操作における手順は、以下のとおりである：種子を混合機の中に入れること、所望される特定量の種子粉衣製剤を、そのままで添加するか又は予め水で希釈したあとで添加すること、及び、該製剤が当該種子の表面に均質に分配されるまで全てを混合させること。適切な場合には、続いて乾燥工程を行う。

【０１２８】
本発明に従う活性化合物又は組成物は、強力な殺微生物活性（ｍｉｃｒｏｂｉｃｉｄａｌ　ａｃｔｉｖｉｔｙ）を有しており、作物保護と材料物質（ｍａｔｅｒｉａｌｓ）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。
【０１２９】
殺菌剤は、作物保護において、ネコブカビ類（Ｐｌａｓｍｏｄｉｏｐｈｏｒｏｍｙｃｅｔｅｓ）、卵菌類（Ｏｏｍｙｃｅｔｅｓ）、ツボカビ類（Ｃｈｙｔｒｉｄｉｏｍｙｃｅｔｅｓ）、接合菌類（Ｚｙｇｏｍｙｃｅｔｅｓ）、子嚢菌類（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。
【０１３０】
殺細菌剤（ｂａｃｔｅｒｉｃｉｄｅ）は、作物保護において、シュードモナス科（Ｐｓｅｕｄｏｍｏｎａｄａｃｅａｅ）、リゾビウム科（Ｒｈｉｚｏｂｉａｃｅａｅ）、腸内細菌科（Ｅｎｔｅｒｏｂａｃｔｅｒｉａｃｅａｅ）、コリネバクテリウム科（Ｃｏｒｙｎｅｂａｃｔｅｒｉａｃｅａｅ）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。
【０１３１】
本発明に従う殺菌剤組成物は、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、本発明に従う活性化合物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連し、ここで、該活性化合物又は組成物は、種子、植物若しくは植物の部分、果実又は植物が生育している土壌に施用される。
【０１３２】
作物保護において植物病原性菌類を防除するための、本発明に従う組成物は、有効で且つ植物に対して毒性を示さない量の本発明に従う活性化合物を含んでいる。「有効で且つ植物に対して毒性を示さない量（ｅｆｆｅｃｔｉｖｅ，　ｂｕｔ　ｎｏｎ－ｐｈｙｔｏｔｏｘｉｃ　ａｍｏｕｎｔ）」は、植物の菌類病を満足のいくように防除するか又は植物の菌類病を完全に根絶するのに充分でありながら、同時に、植物毒性の重大などのような症状も引き起こすことのない、本発明組成物の量を意味する。一般に、そのような施用量は、比較的広い範囲内でさまざまであり得る。それは、複数の要因に依存し、例えば、防除対象の菌類、植物、気候条件及び本発明の組成物の成分などに依存する。
【０１３３】
植物病害を防除するために必要とされる濃度の該活性化合物に対して植物が充分な耐性を示すという事実により、植物の地上部の処理、繁殖用台木（ｐｒｏｐａｇａｔｉｏｎ　ｓｔｏｃｋ）及び種子の処理、並びに、土壌の処理が可能である。
【０１３４】
本発明に従って、全ての植物及び植物の部分を処理することができる。ここで、植物というのは、望ましい及び望ましくない野生植物又は作物植物（自然発生した作物植物を包含する）のような全ての植物及び植物群を意味するものと理解される。作物植物は、慣習的な育種法及び最適化法により、又は、生物工学的方法及び遺伝子工学的方法により、若しくは、それら方法を組み合わせたものにより得ることが可能な植物であることができる。そのような作物植物には、トランスジェニック植物も包含され、また、植物育種家の権利によって保護され得るか又は保護され得ない植物品種も包含される。植物の部分は、植物の地上及び地下の全ての部分及び全ての器官、例えば、枝条、葉、花及び根などを意味するものと理解され、挙げることができる例は、葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実及び種子、並びに、さらに、根、塊茎及び根茎である。植物の部分には、さらに、収穫されたもの、並びに、栄養繁殖器官及び生殖繁殖器官（ｖｅｇｅｔａｔｉｖｅ　ａｎｄ　ｇｅｎｅｒａｔｉｖｅ　ｐｒｏｐａｇａｔｉｏｎ　ｍａｔｅｒｉａｌ）、例えば、挿木（ｃｕｔｔｉｎｇ）、塊茎、根茎、掻き苗（ｓｌｉｐ）及び種子なども包含される。

【０１３５】
本発明に従う活性化合物は、植物及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、収穫された作物の質を向上させるのに適しており、同時に、植物が充分な耐性を示し、温血動物種に対する好ましい毒性を有し、且つ、環境に優しい。それらは、好ましくは、作物保護剤として使用することができる。それらは、通常の感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、また、全ての又は一部の発育段階に対して有効である。
【０１３６】
本発明に従って処理することが可能な植物としては、以下の主要な作物植物を挙げることができる：トウモロコシ、ダイズ、ワタ、アブラナ属油料種子（Ｂｒａｓｓｉｃａ ｏｉｌ ｓｅｅｄｓ）、例えば、セイヨウアブラナ（Ｂｒａｓｓｉｃａ ｎａｐｕｓ）（例えば、カノラ）、カブ（Ｂｒａｓｓｉｃａ ｒａｐａ）、カラシナ（Ｂ．ｊｕｎｃｅａ）（例えば、（フィールド）マスタード）及びアビシニアガラシ（Ｂｒａｓｓｉｃａ ｃａｒｉｎａｔａ）、イネ、コムギ、テンサイ、サトウキビ、エンバク、ライムギ、オオムギ、アワ及びソルガム、ライコムギ、アマ、ブドウの木、並びに、種々の植物学的分類群に属するさまざまな果実及び野菜、例えば、バラ科各種（Ｒｏｓａｃｅａｅ ｓｐ．）（例えば、仁果類、例えば、リンゴ及びナシ、さらに、核果類、例えば、アンズ、サクラ、アーモンド及びモモ、並びに、液果類、例えば、イチゴ）、リベシオイダエ科各種（Ｒｉｂｅｓｉｏｉｄａｅ ｓｐ．）、クルミ科各種（Ｊｕｇｌａｎｄａｃｅａｅ ｓｐ．）、カバノキ科各種（Ｂｅｔｕｌａｃｅａｅ ｓｐ．）、ウルシ科各種（Ａｎａｃａｒｄｉａｃｅａｅ ｓｐ．）、ブナ科各種（Ｆａｇａｃｅａｅ ｓｐ．）、クワ科各種（Ｍｏｒａｃｅａｅ ｓｐ．）、モクセイ科各種（Ｏｌｅａｃｅａｅ ｓｐ．）、マタタビ科各種（Ａｃｔｉｎｉｄａｃｅａｅ ｓｐ．）、クスノキ科各種（Ｌａｕｒａｃｅａｅ ｓｐ．）、バショウ科各種（Ｍｕｓａｃｅａｅ ｓｐ．）（例えば、バナナの木及びプランテーション）、アカネ科各種（Ｒｕｂｉａｃｅａｅ ｓｐ．）（例えば、コーヒー）、ツバキ科各種（Ｔｈｅａｃｅａｅ ｓｐ．）、アオギリ科各種（Ｓｔｅｒｃｕｌｉｃｅａｅ ｓｐ．）、ミカン科各種（Ｒｕｔａｃｅａｅ ｓｐ．）（例えば、レモン、オレンジ及びグレープフルーツ）；ナス科各種（Ｓｏｌａｎａｃｅａｅ ｓｐ．）（例えば、トマト、ジャガイモ、トウガラシ、ナス）、ユリ科各種（Ｌｉｌｉａｃｅａｅ ｓｐ．）、キク科各種（Ｃｏｍｐｏｓｉｔａｅ ｓｐ．）（例えば、レタス、チョウセンアザミ及びチコリー（これは、ルートチコリー（ｒｏｏｔ ｃｈｉｃｏｒｙ）、エンダイブ又はキクニガナ（ｃｏｍｍｏｎ ｃｈｉｃｏｒｙ）を包含する））、セリ科各種（Ｕｍｂｅｌｌｉｆｅｒａｅ ｓｐ．）（例えば、ニンジン、パセリ、セロリ及びセルリアック）、ウリ科各種（Ｃｕｃｕｒｂｉｔａｃｅａｅ ｓｐ．）（例えば、キュウリ（これは、ガーキンを包含する）、カボチャ、スイカ、ヒョウタン及びメロン）、ネギ科各種（Ａｌｌｉａｃｅａｅ ｓｐ．）（例えば、リーキ及びタマネギ）、アブラナ科各種（Ｃｒｕｃｉｆｅｒａｅ ｓｐ．）（例えば、白キャベツ、赤キャベツ、ブロッコリー、カリフラワー、芽キャベツ、タイサイ、コールラビ、ラディッシュ、セイヨウワサビ、コショウソウ及びハクサイ）、マメ科各種（Ｌｅｇｕｍｉｎｏｓａｅ ｓｐ．）（例えば、ラッカセイ、エンドウ及びインゲンマメ（例えば、インゲンマメ（ｃｏｍｍｏｎ ｂｅａｎ）及びソラマメ））、アカザ科各種（Ｃｈｅｎｏｐｏｄｉａｃｅａｅ ｓｐ．）（例えば、フダンソウ、飼料用ビート、ホウレンソウ、ビートルート）、アオイ科（Ｍａｌｖａｃｅａｅ）（例えば、オクラ）、クサスギカズラ科（Ａｓｐａｒａｇａｃｅａｅ）（例えば、アスパラガス）；庭園及び森林における有用な植物及び観賞植物；及び、各々の場合において、これら植物の遺伝子組み換えが行われたタイプのもの。
【０１３７】
上記で既に述べたように、本発明に従って、全ての植物及びそれらの部分を処理することができる。好ましい実施形態では、野生の植物種及び植物品種、又は、交雑若しくはプロトプラスト融合のような慣習的な生物学的育種法により得られた植物種及び植物品種、並びに、それらの部分を処理する。好ましいさらなる実施形態では、適切な場合には慣習

的な方法と組み合わせた遺伝子工学により得られたトランスジェニック植物及び植物品種（遺伝子組換え生物）並びにそれらの部分を処理する。用語「部分（ｐａｒｔｓ）」又は「植物の部分（ｐａｒｔｓ　ｏｆ　ｐｌａｎｔｓ）」又は「植物の部分（ｐｌａｎｔ　ｐａｒｔｓ）」については、既に上記で説明した。さらに好ましくは、市販されているか又は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。植物品種は、慣習的な育種、突然変異誘発又は組換えＤＮＡ技術によって得られた、新しい特性（「形質」）を有する植物を意味するものと理解される。これらは、品種、変種、生物型又は遺伝子型であってよい。

【０１３８】

本発明に従う処理方法は、遺伝子組換え生物（ＧＭＯ）、例えば、植物又は種子などの処理においても使用することができる。遺伝子組換え植物（又は、トランスジェニック植物）は、異種遺伝子がゲノムに安定的に組み込まれている植物である。表現「異種遺伝子」は、本質的に、供給されたか又は当該植物の外部で構築された遺伝子であって、且つ、核のゲノム、葉緑体のゲノム又はミトコンドリアのゲノムの中に導入されたときに、興味深いタンパク質若しくはポリペプチドを発現することにより、又は、その植物体内に存在している別の１つ若しくは複数の遺伝子をダウンレギュレート若しくはサイレンシングすることにより、当該形質転換された植物に新規の若しくは改善された作物学的特性又は別の特性を付与する遺伝子を意味する〔例えば、アンチセンス技術、コサプレッション技術又はＲＮＡｉ技術［ＲＮＡ干渉］などを使用する〕。ゲノム内に存在している異種遺伝子は、導入遺伝子とも称される。植物ゲノム内におけるその特異的な存在によって定義される導入遺伝子は、形質転換又は遺伝子導入イベントと称される。

【０１３９】

植物種又は植物品種、それらの生育場所及び生育条件（土壌、気候、生育期、養分（ｄｉｅｔ））に応じて、本発明の処理により、相加効果を超える効果（「相乗効果」）も生じ得る。例えば、実際に予期される効果を超える以下の効果が可能である：本発明により使用し得る活性化合物及び組成物の施用量の低減及び／又は活性スペクトルの拡大及び／又は活性の増強、植物の生育の向上、高温又は低温に対する耐性の向上、渇水又は水中若しくは土壌中に含まれる塩分に対する耐性の向上、開花能力の向上、収穫の容易性の向上、促進された成熟、収穫量の増加、果実の大きさの増大、植物の高さの増大、葉の緑色の向上、より早い開花、収穫された生産物の品質の向上及び／又は栄養価の増加、果実内の糖度の上昇、収穫された生産物の貯蔵安定性の向上及び／又は加工性の向上。

【０１４０】

特定の施用量において、本発明に従う活性化合物は、植物に対して強化効果も示し得る。従って、それらは、望ましくない植物病原性の菌類及び／又は微生物類及び／又はウイルス類による攻撃に対して植物の防御システムを動員させるのに適している。これは、適切な場合には、本発明に従う組合せの例えば菌類に対する強化された活性の理由のうちの１つであり得る。植物を強化する（抵抗性を誘導する）物質は、本発明に関連して、処理された植物が、その後に望ましくない植物病原性菌類を接種されたときに、それらの望ましくない植物病原性菌類に対して実質的な程度の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又は物質の組合せも意味するものと理解されるべきである。従って、処理後ある一定の期間、上記病原体による攻撃から植物を保護するために、本発明の物質を用いることができる。保護が達成される期間は、植物が該活性化合物で処理されてから、一般に、１～１０日間、好ましくは、１～７日間に及ぶ。

【０１４１】

本発明に従って処理するのが好ましい植物及び植物品種には、特に有利かつ有用な形質を植物に付与する遺伝物質を有している全ての植物（育種によって得られたものであろうと、及び／又は、生物工学的手段によって得られたものであろうと）が包含される。

【０１４２】

本発明に従って処理するのが同様に好ましい植物及び植物品種は、１以上の生物的ストレス因子に対して抵抗性を示す。即ち、前記植物は、害虫及び有害微生物に対して、例え

ば、線虫類、昆虫類、ダニ類、植物病原性の菌類、細菌類、ウイルス類及び／又はウイロイド類などに対して、良好な防御を示す。

【０１４３】

線虫抵抗性植物の例は、例えば、以下の米国特許出願に記載されている：１１／７６５，４９１、１１／７６５，４９４、１０／９２６，８１９、１０／７８２，０２０、１２／０３２，４７９、１０／７８３，４１７、１０／７８２，０９６、１１／６５７，９６４、１２／１９２，９０４、１１／３９６，８０８、１２／１６６，２５３、１２／１６６，２３９、１２／１６６，１２４、１２／１６６，２０９、１１／７６２，８８６、１２／３６４，３３５、１１／７６３，９４７、１２／２５２，４５３、１２／２０９，３５４、１２／４９１，３９６、及び、１２／４９７，２２１。

【０１４４】

本発明に従って同様に処理し得る植物及び植物品種は、１以上の非生物的ストレス因子に対して抵抗性を示す植物である。非生物的なストレス状態としては、例えば、渇水、低温曝露、熱への曝露、浸透ストレス、湛水、土壌中の増大した塩分、鉱物への増加した曝露、オゾンへの曝露、強い光への曝露、限られた利用可能な窒素養分、限られた利用可能なリン養分、日陰回避などを挙げることができる。

【０１４５】

本発明に従って同様に処理し得る植物及び植物品種は、増大した収量特性を特徴とする植物である。そのような植物における増大した収量は、例えば、植物の改善された生理機能、植物の改善された生長及び発育、例えば、水の利用効率、水の保持効率、改善された窒素の利用性、強化された炭素同化作用、改善された光合成、上昇した発芽効率及び促進された成熟の結果であり得る。収量は、さらに、改善された植物の構成（ａｒｃｈｉｔｅｃｔｕｒｅ）によっても影響され得る（ストレス条件下及び非ストレス条件下）。そのような改善された植物の構成としては、早咲き、ハイブリッド種子産生のための開花制御、実生の活力、植物の寸法、節間の数及び距離、根の成長、種子の寸法、果実の寸法、莢の寸法、莢又は穂の数、１つの莢又は穂当たりの種子の数、種子のかさ、強化された種子充填、低減された種子分散、低減された莢の裂開及び耐倒伏性などがある。収量についてのさらなる形質としては、種子の組成、例えば、炭水化物含有量、タンパク質含有量、油含有量及び油の組成、栄養価、抗栄養化合物の低減、改善された加工性並びに向上した貯蔵安定性などがある。

【０１４６】

本発明に従って処理し得る植物は、雑種強勢又は雑種効果（これは、結果として、一般に、増加した収量、向上した活力、向上した健康状態並びに生物的及び非生物的ストレス因子に対する向上した抵抗性をもたらす）の特性を既に呈しているハイブリッド植物である。そのような植物は、典型的には、雄性不稔交配母体近交系（ｉｎｂｒｅｄ ｍａｌｅ ｓｔｅｒｉｌｅ ｐａｒｅｎｔ ｌｉｎｅ）（雌性親）を別の雄性稔性交配母体近交系（ｉｎｂｒｅｄ ｍａｌｅ ｆｅｒｔｉｌｅ ｐａｒｅｎｔ ｌｉｎｅ）（雄性親）と交雑させることによって生成される。ハイブリッド種子は、典型的には、雄性不稔植物から収穫され、そして、栽培者に販売される。雄性不稔植物は、場合により（例えば、トウモロコシにおいて）、雄穂を除去することによって〔即ち、雄性繁殖器官又は雄花を機械的に除去することによって〕、作ることができる。しかしながら、より典型的には、雄性不稔性は、植物ゲノム内の遺伝的決定基の結果である。その場合、及び、特に種子がハイブリッド植物から収穫される所望の生産物である場合、典型的には、雄性不稔性に関与する遺伝的決定基を含んでいる該ハイブリッド植物において雄性稔性を確実に完全に回復させることは有益である。これは、雄性不稔性に関与する遺伝的決定基を含んでいるハイブリッド植物において雄性稔性を回復させることが可能な適切な稔性回復遺伝子を雄性親が有していることを確実なものとすることによって達成することができる。雄性不稔性に関する遺伝的決定基は、細胞質内に存在し得る。細胞質雄性不稔（ＣＭＳ）の例は、例えば、アブラナ属各種（Ｂｒａｓｓｉｃａ ｓｐｅｃｉｅｓ）に関して記述された。しかしながら、雄性不稔性に関する遺伝的決定基は、核ゲノム内にも存在し得る。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特に有用な方法は、ＷＯ　８９／１０３９６に記載されており、ここでは、例えば、バルナーゼなどのリボヌクレアーゼを雄ずい内のタペータム細胞において選択的に発現させる。次いで、タペータム細胞内においてバルスターなどのリボヌクレアーゼインヒビターを発現させることによって、稔性を回復させることができる。

【０１４７】

本発明に従って処理し得る植物又は植物品種（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た）は、除草剤耐性植物、即ち、１種類以上の所与の除草剤に対して耐性にされた植物である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、当該除草剤耐性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。

【０１４８】

除草剤耐性植物は、例えば、グリホセート耐性植物、即ち、除草剤グリホセート又はその塩に対して耐性にされた植物である。植物は、種々の方法によって、グリホセートに対して耐性にすることができる。例えば、グリホセート耐性植物は、酵素５－エノールピルビルシキミ酸－３－リン酸シンターゼ（ＥＰＳＰＳ）をコードする遺伝子で植物を形質転換させることによって得ることができる。そのようなＥＰＳＰＳ遺伝子の例は、以下のものである：細菌サルモネラ・チフィムリウム（Ｓａｌｍｏｎｅｌｌａ　ｔｙｐｈｉｍｕｒｉｕｍ）のＡｒｏＡ遺伝子（突然変異ＣＴ７）（Ｃｏｍａｉ　ｅｔ　ａｌ．，１９８３，Ｓｃｉｅｎｃｅ　２２１，３７０－３７１）、細菌アグロバクテリウム属各種（Ａｇｒｏｂａｃｔｅｒｉｕｍ　ｓｐ．）のＣＰ４遺伝子（Ｂａｒｒｙ　ｅｔ　ａｌ．，１９９２，Ｃｕｒｒ．Ｔｏｐｉｃｓ　Ｐｌａｎｔ　Ｐｈｙｓｉｏｌ．７，１３９－１４５）、ペチュニアのＥＰＳＰＳをコードする遺伝子（Ｓｈａｈ　ｅｔ　ａｌ．，１９８６，Ｓｃｉｅｎｃｅ　２３３，４７８－４８１）、トマトのＥＰＳＰＳをコードする遺伝子（Ｇａｓｓｅｒ　ｅｔ　ａｌ．，Ｊ．Ｂｉｏｌ．Ｃｈｅｍ．２６３，４２８０－４２８９）又はオヒシバ属（Ｅｌｅｕｓｉｎｅ）のＥＰＳＰＳをコードする遺伝子（ＷＯ　０１／６６７０４）。それは、突然変異ＥＰＳＰＳであることも可能である。グリホセート耐性植物は、さらにまた、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、さらにまた、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、さらにまた、上記遺伝子の自然発生突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることもできる。グリホセート耐性を付与するＥＰＳＰＳ遺伝子を発現する植物は、既に記述されている。グリホセート耐性を付与する別の遺伝子（例えば、デカルボキシラーゼ遺伝子）を発現する植物は、既に記述されている。

【０１４９】

別の除草剤抵抗性植物は、例えば、酵素グルタミンシンターゼを阻害する除草剤（例えば、ビアラホス、ホスフィノトリシン又はグルホシネート）に対して耐性にされている植物である。そのような植物は、当該除草剤を解毒する酵素を発現させるか、又は、阻害に対して抵抗性を示す突然変異グルタミンシンターゼ酵素を発現させることによって、得ることができる。かかる有効な解毒酵素の一つは、例えば、ホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼをコードする酵素である（例えば、ストレプトマイセス属各種（Ｓｔｒｅｐｔｏｍｙｃｅｓ　ｓｐｅｃｉｅｓ）に由来するｂａｒタンパク質又はｐａｔタンパク質）。外因性のホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼを発現する植物については、記述されている。

【０１５０】

さらなる除草剤耐性植物は、さらにまた、酵素ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ（ＨＰＰＤ）を阻害する除草剤に対して耐性にされている植物である。ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ類は、パラ－ヒドロキシフェニルピルベート（ＨＰＰ）がホモゲンチセートに変換される反応を触媒する酵素である。ＨＰＰＤ阻害薬に対

して耐性を示す植物は、ＷＯ　９６／３８５６７、ＷＯ　９９／２４５８５、ＷＯ　９９／２４５８６、ＷＯ　２００９／１４４０７９、ＷＯ　２００２／０４６３８７又はＵＳ　６，７６８，０４４に記述されているように、自然発生抵抗性ＨＰＰＤ酵素をコードする遺伝子を用いて、又は、突然変異ＨＰＰＤ酵素若しくはキメラＨＰＰＤ酵素をコードする遺伝子を用いて、形質転換させることができる。ＨＰＰＤ阻害薬に対する耐性は、さらにまた、ＨＰＰＤ阻害薬による天然ＨＰＰＤ酵素の阻害にもかかわらず、ホモゲンチセートを形成させることが可能な特定の酵素をコードする遺伝子を用いて植物を形質転換させることによっても得ることができる。そのような植物は、ＷＯ　９９／３４００８及びＷＯ　０２／３６７８７に記述されている。ＨＰＰＤ阻害薬に対する植物の耐性は、さらにまた、ＷＯ　２００４／０２４９２８に記述されているように、ＨＰＰＤ耐性酵素をコードする遺伝子に加えて酵素プレフェナートデヒドロゲナーゼをコードする遺伝子を用いて植物を形質転換させることによって改善することもできる。さらに、植物は、そのゲノムの中にＨＰＰＤ阻害薬を代謝又は分解する酵素（例えば、ＣＹＰ４５０酵素）をコードする遺伝子を挿入することによって、ＨＰＰＤ阻害薬に対してさらに耐性にすることができる（ＷＯ　２００７／１０３５６７、及び、ＷＯ　２００８／１５０４７３）。

【０１５１】

さらなる除草剤抵抗性植物は、アセトラクテートシンターゼ（ＡＬＳ）阻害薬に対して耐性にされている植物である。既知ＡＬＳ阻害薬としては、例えば、スルホニル尿素系除草剤、イミダゾリノン系除草剤、トリアゾロピリミジン系除草剤、ピリミジニルオキシ（チオ）ベンゾエート系除草剤、及び／又は、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。ＡＬＳ酵素（「アセトヒドロキシ酸シンターゼ（ＡＨＡＳ）」としても知られている）における種々の突然変異体は、例えば「Ｔｒａｎｅｌ　ａｎｄ　Ｗｒｉｇｈｔ　（Ｗｅｅｄ　Ｓｃｉｅｎｃｅ　２００２，　５０：７００－７１２）」に記述されているように、種々の除草剤及び除草剤の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及びイミダゾリノン耐性植物の作製については、既に記述されている。さらなるスルホニル尿素耐性植物及びイミダゾリノン耐性植物についても、既に記述されている。

【０１５２】

イミダゾリノン及び／又はスルホニル尿素に対して耐性を示すさらなる植物は、誘導された突然変異誘発によって得ることができるか、当該除草剤の存在下での細胞培養における選抜によって得ることができるか、又は、突然変異育種によって得ることができる（ｃｆ．　例えば、ダイズに関しては、ＵＳ　５，０８４，０８２、イネに関しては、ＷＯ　９７／４１２１８、テンサイに関しては、ＵＳ　５，７７３，７０２及びＷＯ　９９／０５７９６５、レタスに関してはＵＳ　５，１９８，５９９、又は、ヒマワリに関してはＷＯ　０１／０６５９２２）。

【０１５３】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種（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た）は、昆虫抵抗性トランスジェニック植物、即ち、特定の標的昆虫による攻撃に対して抵抗性にされた植物である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、そのような昆虫抵抗性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。

【０１５４】

本明細に関連して、用語「昆虫抵抗性トランスジェニック植物」には、以下のものをコードするコード配列を含んでいる少なくとも１つの導入遺伝子を含んだ任意の植物が包含される：

（１）　バシルス・ツリンギエンシス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓ）に由来する殺虫性結晶タンパク質又はその殺虫活性を示す一部分、例えば、クリックモアら「Ｃｒｉｃｋｍｏｒｅ　ｅｔ　ａｌ．（Ｍｉｃｒｏｂｉｏｌｏｇｙ　ａｎｄ　Ｍｏｌｅｃｕｌａｒ　Ｂｉｏｌｏｇｙ　Ｒｅｖｉｅｗｓ　１９９８，　６２，　８０７－８１３）」によって編集され、クリックモアら「Ｃｒｉｃｋｍｏｒｅ　ｅｔ　ａｌ．（２

００５）」によって、オンライン「ｈｔｔｐ：／／ｗｗｗ．ｌｉｆｅｓｃｉ．ｓｕｓｓｅｘ．ａｃ．ｕｋ／Ｈｏｍｅ／Ｎｅｉｌ＿Ｃｒｉｃｋｍｏｒｅ／Ｂｔ／」上で「バシルス・ツリンギエンシス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓ）毒素命名法」において更新された殺虫性結晶タンパク質又はその殺虫活性を示す一部分、例えば、Ｃｒｙタンパク質類のタンパク質（Ｃｒｙ１Ａｂ、Ｃｒｙ１Ａｃ、Ｃｒｙ１Ｂ、Ｃｒｙ１Ｃ、Ｃｒｙ１Ｄ、Ｃｒｙ１Ｆ、Ｃｒｙ２Ａｂ、Ｃｒｙ３Ａａ、又は、Ｃｒｙ３Ｂｂ）若しくはその殺虫活性を示す一部分（例えば、ＥＰ－Ａ　１９９９１４１、及び、ＷＯ　２００７／１０７３０２）、又は、米国特許出願第１２／２４９，０１６号に記載されている合成遺伝子によってコードされているタンパク質；又は、

（２）　バシルス・ツリンギエンシス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓ）としての第２の別の結晶タンパク質又はその一部分の存在下において殺虫活性を示す、バシルス・ツリンギエンシス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓ）に由来する結晶タンパク質又はその一部分、例えば、Ｃｒｙ３４結晶タンパク質とＣｒｙ３５結晶タンパク質で構成されているバイナリートキシン（Ｎａｔ．　Ｂｉｏｔｅｃｈｎｏｌ．　２００１，　１９，　６６８－７２；　Ａｐｐｌｉｅｄ　Ｅｎｖｉｒｏｎｍ．　Ｍｉｃｒｏｂｉｏｌ．　２００６，　７１，　１７６５－１７７４）、又は、Ｃｒｙ１Ａ若しくはＣｒｙ１Ｆタンパク質とＣｒｙ２Ａａ若しくはＣｒｙ２Ａｂ若しくはＣｒｙ２Ａｅタンパク質からなるバイナリートキシン（米国特許出願第１２／２１４，０２２号、及び、ＥＰ　０８０１０７９１．５）；又は、

（３）　バシルス・ツリンギエンシス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓ）に由来する２種類の異なった殺虫性結晶タンパク質の一部分を含んでいる殺虫性ハイブリッドタンパク質、例えば、上記（１）のタンパク質のハイブリッド、又は、上記（２）のタンパク質のハイブリッド、例えば、トウモロコシイベントＭＯＮ９８０３４で産生されるＣｒｙ１Ａ．１０５タンパク質（ＷＯ　２００７／０２７７７７）；又は、

（４）　上記項目（１）～（３）のいずれか１つのタンパク質において、標的昆虫種に対するさらに強い殺虫活性を得るために、及び／又は、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するために、及び／又は、クローニング若しくは形質転換の間にコード化ＤＮＡ中に誘導された変化に起因して、幾つかの（特に、１～１０の）アミノ酸が別のアミノ酸で置き換えられていているもの、例えば、トウモロコシイベントＭＯＮ８６３若しくはＭＯＮ８８０１７におけるＣｒｙ３Ｂｂ１タンパク質又はトウモロコシイベントＭＩＲ６０４におけるＣｒｙ３Ａタンパク質；又は、

（５）　バシルス・ツリンギエンシス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓ）又はバシルス・セレウス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｃｅｒｅｕｓ）に由来する殺虫性分泌タンパク質又はその殺虫活性を示す一部分、例えば、「ｈｔｔｐ：／／ｗｗｗ．ｌｉｆｅｓｃｉ．ｓｕｓｓｅｘ．ａｃ．ｕｋ／ｈｏｍｅ／Ｎｅｉｌ＿Ｃｒｉｃｋｍｏｒｅ／Ｂｔ／ｖｉｐ．ｈｔｍｌ」において挙げられている栄養生長期殺虫性タンパク質（ｖｅｇｅｔａｔｉｖｅ　ｉｎｓｅｃｔｉｃｉｄａｌ　ｐｒｏｔｅｉｎ）（ＶＩＰ）、例えば、ＶＩＰ３Ａａタンパク質類のタンパク質；又は、

（６）　バシルス・ツリンギエンシス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓ）又はバシルス・セレウス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｃｅｒｅｕｓ）に由来する第２の分泌タンパク質の存在下において殺虫活性を示す、バシルス・ツリンギエンシス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓ）又はバシルス・セレウス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｃｅｒｅｕｓ）に由来する分泌タンパク質、例えば、ＶＩＰ１Ａタンパク質とＶＩＰ２Ａタンパク質で構成されているバイナリートキシン（ＷＯ　９４／２１７９５）；又は、

（７）　バシルス・ツリンギエンシス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓ）又はバシルス・セレウス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｃｅｒｅｕｓ）に由来する異なった分泌タンパク質の一部分を含んでいる殺虫性ハイブリッドタンパク質、例えば、上記（１）のタンパク質のハイブリッド、又は、上記（２）のタンパク質のハイブリッド；又は、

（８）　上記項目（５）～（７）のいずれか１つのタンパク質において、標的昆虫種に対するさらに強い殺虫活性を得るために、及び／又は、影響を受ける標的昆虫種の範囲を

拡大するために、及び／又は、クローニング若しくは形質転換の間にコード化ＤＮＡ中に誘導された変化（それでも、なお、殺虫性タンパク質をコードしている）に起因して、幾つかの（特に、１～１０）のアミノ酸が別のアミノ酸で置き換えられていているもの、例えば、ワタイベントＣＯＴ１０２におけるＶＩＰ３Ａａタンパク質；又は、

（９） バシルス・ツリンギエンシス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓ）に由来する結晶タンパク質の存在下において殺虫活性を示す、バシルス・ツリンギエンシス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓ）又はバシルス・セレウス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ ｃｅｒｅｕｓ）に由来する分泌タンパク質、例えば、ＶＩＰ３とＣｒｙ１Ａ若しくはＣｒｙ１Ｆで構成されているバイナリートキシン（米国特許出願第６１／１２６０８３号、及び、米国特許出願第６１／１９５０１９号）、又は、ＶＩＰ３タンパク質とＣｒｙ２Ａａタンパク質若しくはＣｒｙ２Ａｂタンパク質若しくはＣｒｙ２Ａｅタンパク質で構成されているバイナリートキシン（米国特許出願第１２／２１４，０２２号、及び、ＥＰ ０８０１０７９１．５）；又は、

（１０） 上記（９）のタンパク質において、標的昆虫種に対するさらに強い殺虫活性を得るために、及び／又は、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するために、及び／又は、クローニング若しくは形質転換に際してコード化ＤＮＡ中に導入された変化（それでも、なお、殺虫性タンパク質をコードしている）に起因して、幾つかの（特に、１～１０）のアミノ酸が別のアミノ酸で置き換えられていているもの。

【０１５５】

もちろん、「昆虫抵抗性トランスジェニック植物」は、本明細書中で使用される場合、上記クラス（１）～（１０）のいずれか１つのタンパク質をコードする遺伝子の組合せを含んでいる任意の植物も包含する。一実施形態では、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するために、又は、同一の標的昆虫種に対して殺虫活性を示すが作用機序は異なっている（例えば、当該昆虫体内の異なった受容体結合部位に結合する）異なったタンパク質を用いることによって当該植物に対する昆虫の抵抗性の発達を遅延させるために、昆虫抵抗性植物は、上記クラス（１）～（１０）のいずれか１つのタンパク質をコードする２つ以上の導入遺伝子を含んでいる。

【０１５６】

本発明に関連して、「昆虫抵抗性トランスジェニック植物」は、さらに、食物が害虫によって消費された後で、その害虫の成長を妨げる二本鎖ＲＮＡを産生するための配列を含んでいる少なくとも１の導入遺伝子を含んでいる任意の植物も包含する。

【０１５７】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種（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た）は、非生物的ストレス因子に対して耐性を示す。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、そのようなストレス抵抗性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜すること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としては、以下のものなどがある：

（ａ） 植物細胞内又は植物体内におけるポリ（ＡＤＰ－リボース）ポリメラーゼ（ＰＡＲＰ）遺伝子の発現及び／又は活性を低減させることが可能な導入遺伝子を含んでいる植物；

（ｂ） 植物又は植物細胞のＰＡＲＧコード化遺伝子の発現及び／又は活性を低減させることが可能なストレス耐性を強化する導入遺伝子を含んでいる植物；

（ｃ） ニコチンアミダーゼ、ニコチン酸ホスホリボシルトランスフェラーゼ、ニコチン酸モノヌクレオチドアデニルトランスフェラーゼ、ニコチンアミドアデニンジヌクレオチドシンテターゼ又はニコチンアミドホスホリボシルトランスフェラーゼを包含するニコチンアミドアデニンジヌクレオチドサルベージ生合成経路の植物機能性酵素（ｐｌａｎｔ－ｆｕｎｃｔｉｏｎａｌ ｅｎｚｙｍｅ）をコードするストレス耐性を強化する導入遺伝子を含んでいる植物。

【０１５８】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種（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た）は、収穫された生産物の改変された量、品質及び／若しくは貯蔵安定性、並びに／又は、収穫された生産物の特定の成分の改変された特性を示す。例えば：

（１） 野生型の植物細胞又は植物において合成された澱粉と比較して、その物理化学的形質〔特に、アミロース含有量若しくはアミロース／アミロペクチン比、枝分かれ度、平均鎖長、側鎖の分布、粘性挙動、ゲル抵抗（ｇｅｌ　ｒｅｓｉｓｔａｎｃｅ）、澱粉粒径及び／又は澱粉の粒子形態〕に関して改変されていて、特定の用途により適した変性澱粉を合成するトランスジェニック植物；

（２） 非澱粉炭水化物ポリマーを合成するか、又は、遺伝子組換えがなされていない野生型植物と比較して改変された特性を有する非澱粉炭水化物ポリマーを合成する、トランスジェニック植物〔その例は、ポリフルクトース（特に、イヌリン型及びレバン型のポリフルクトース）を産生する植物、α－１，４－グルカン類を産生する植物、α－１，６－分枝　α－１，４－グルカン類を産生する植物、及び、アルテルナンを産生する植物である〕；

（３） ヒアルロナンを産生するトランスジェニック植物；

（４） トランスジェニック植物又はハイブリッド植物、例えば、「可溶性固形物高含有量」、「低辛味」（ＬＰ）及び／又は「長期保存」（ＬＳ）などの特性を有するタマネギ。

【０１５９】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種（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た）は、改変された繊維特性を有する植物（例えば、ワタ植物）である。そのよう植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、そのような改変された繊維特性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。そのような植物としては、以下のものが挙げられる：

（ａ） セルロースシンターゼ遺伝子の改変された形態を含んでいる植物（例えば、ワタ植物）；

（ｂ） ｒｓｗ２相同核酸又はｒｓｗ３相同核酸の改変された形態を含んでいる植物（例えば、ワタ植物）、例えば、スクロースリン酸シンターゼの発現が増大しているワタ植物；

（ｃ） スクロースシンターゼの発現が増大している植物（例えば、ワタ植物）；

（ｄ） 繊維細胞に基づいた原形質連絡のゲーティングのタイミングが（例えば、繊維選択的β－１，３－グルカナーゼのダウンレギュレーションを介して）改変されている植物（例えば、ワタ植物）；

（ｅ） 反応性が（例えば、ｎｏｄＣを包含するＮ－アセチルグルコサミントランスフェラーゼ遺伝子の発現及びキチンシンターゼ遺伝子の発現を介して）改変されている繊維を有する植物（例えば、ワタ植物）。

【０１６０】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種（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た）は、改変されたオイルプロフィール特性を有する植物（例えば、ナタネ植物又は関連するアブラナ属植物）である。そのよう植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、そのような改変されたオイル特性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。そのような植物としては、以下のものが挙げられる：

（ａ） オレイン酸含有量が高いオイルを産生する植物（例えば、ナタネ植物）；

（ｂ） リノレン酸含有量が低いオイルを産生する植物（例えば、ナタネ植物）；

（ｃ） 飽和脂肪酸のレベルが低いオイルを産生する植物（例えば、ナタネ植物）。

【０１６１】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種（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た）は、ウイルス抵抗性を示す〔例えば、ジャガイモウイルスＹに対してウイルス抵抗性を示す（ＳＹ２３０イベント及びＳＹ２３３イベント、Ｔｅｃ

ｎｏｐｌａｎｔ，Ａｒｇｅｎｔｉｎａ）〕ジャガイモ又は病害（例えば、ジャガイモ疫病）に対して抵抗性を示すジャガイモ（例えば、ＲＢ遺伝子）又は低減された低温誘発甘味を示すジャガイモ（これは、遺伝子Ｎｔ－Ｉｎｈ、遺伝子ＩＩ－ＩＮＶを有している）又は矮性表現型を示すジャガイモ（Ａ－２０オキシダーゼ遺伝子）などの植物である。

【０１６２】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種（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た）は、改変された種子脱粒特性を有する植物（例えば、ナタネ植物又は関連するアブラナ属植物）である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、そのような改変された特性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。そのような植物としては、種子の脱粒が遅延されているか又は低減されている植物（例えば、ナタネ植物）などがある。

【０１６３】

本発明に従って処理し得る特に有用なトランスジェニック植物は、アメリカ合衆国内における規制除外（ｎｏｎ－ｒｅｇｕｌａｔｅｄ　ｓｔａｔｕｓ）についてのアメリカ合衆国農務省（ＵＳＤＡ）の動植物検疫局（ＡＰＨＩＳ）に対する認可申請又は継続申請の対象である、形質転換イベント又は形質転換イベントの組合せを含んでいる植物である。これに関連する情報は、ＡＰＨＩＳ（４７００　Ｒｉｖｅｒ　Ｒｏａｄ　Ｒｉｖｅｒｄａｌｅ，　ＭＤ　２０７３７，ＵＳＡ）から、例えば、ウェブサイト「ｈｔｔｐ：／／ｗｗｗ．ａｐｈｉｓ．ｕｓｄａ．ｇｏｖ／ｂｒｓ／ｎｏｔ＿ｒｅｇ．ｈｔｍｌ」を介して、いつ何時でも入手することができる。本出願の出願日において、下記情報を有する申請は、ＡＰＨＩＳによって許可されたか又はＡＰＨＩＳが審理中である：

－　申請：　当該申請の識別番号。形質転換イベントについての技術的な記述は、ＡＰＨＩＳからそのウェブサイトにおいて入手可能な特定の申請書類の中に、当該申請番号によって見いだすことができる。それらの記述は、参照によって本明細書中に開示される。

－　申請の拡張：　範囲又は期間の拡張が請求されている、先の申請についての言及。

－　機関：　当該申請を提出している人の名称。

－　規制物：　当該植物種。

－　トランスジェニック表現型：　形質転換イベントによって植物に付与された形質。

－　形質転換イベント又はライン：　規制除外が請求されている１つ又は複数のイベント（場合により、ライン（単数又は複数）とも称される）の名称。

－　ＡＰＨＩＳ文書：　申請に関連してＡＰＨＩＳによって刊行されているか、又は、請求によりＡＰＨＩＳから入手可能な、種々の文書。

【０１６４】

本発明に従って処理し得る特に有用なトランスジェニック植物は、１種類以上の毒素をコードする１種類以上の遺伝子を含んでいる植物であり、且つ、以下の商品名で販売されるトランスジェニック植物である：ＹＩＥＬＤ　ＧＡＲＤ（登録商標）（例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ）、ＫｎｏｃｋＯｕｔ（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、ＢｉｔｅＧａｒｄ（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）、Ｂｏｌｌｇａｒｄ（登録商標）（ワタ）、Ｎｕｃｏｔｎ（登録商標）（ワタ）、Ｎｕｃｏｔｎ　３３Ｂ（登録商標）（ワタ）、ＮａｔｕｒｅＧａｒｄ（登録商標）（例えば、トウモロコシ）、Ｐｒｏｔｅｃｔａ（登録商標）及びＮｅｗＬｅａｆ（登録商標）（ジャガイモ）。言及すべき除草剤耐性植物の例は、以下の商品名で入手可能なトウモロコシ品種、ワタ品種及びダイズ品種である：Ｒｏｕｎｄｕｐ　Ｒｅａｄｙ（登録商標）（グリホセートに対する耐性、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に対する耐性、例えば、ナタネ）、ＩＭＩ（登録商標）（イミダゾリノン系に対する耐性）及びＳＣＳ（登録商標）（スルホニル尿素系に対する耐性、例えば、トウモロコシ）。言及すべき除草剤抵抗性植物（除草剤耐性に関して慣習的な方法で品種改良された植物）としては、Ｃｌｅａｒｆｉｅｌｄ（登録商標）（例えば、トウモロコシ）の商品名で販売される品種などがある。

【０１６５】
本発明に従って処理し得る特に有用なトランスジェニック植物は、形質転換イベント又は形質転換イベントの組合せを含んでいる植物であり、それらは、例えば、国又は地域のさまざまな規制機関に関するデータベースに記載されている〔例えば、「ｈｔｔｐ：／／ｃｅｒａ－ｇｍｃ．ｏｒｇ／ｉｎｄｅｘ．ｐｈｐ？ｅｖｉｄｃｏｄｅ＝＆ｈｓｔＩＤＸＣｏｄｅ＝＆ｇＴｙｐｅ＝＆ＡｂｂｒＣｏｄｅ＝＆ａｔＣｏｄｅ＝＆ｓｔＣｏｄｅ＝＆ｃｏＩＤＣｏｄｅ＝＆ａｃｔｉｏｎ＝ｇｍ＿ｃｒｏｐ＿ｄａｔａｂａｓｅ＆ｍｏｄｅ＝Ｓｕｂｍｉｔ」及び「ｈｔｔｐ：／／ｇｍｏｉｎｆｏ．ｊｒｃ．ｉｔ／ｇｍｐ＿ｂｒｏｗｓｅ．ａｓｐｘ」を参照されたい〕。

【０１６６】
さらにまた、本発明に従う活性化合物又は組成物は、材料物質の保護において、望ましくない微生物（例えば、菌類）及び昆虫類等による攻撃及び破壊から工業材料を保護するために用いることもできる。

【０１６７】
さらに、本発明に従う化合物は、単独で、又は、別の活性化合物と組み合わせて、防汚組成物として用いることもできる。

【０１６８】
本発明に関連して、工業材料とは、工業において使用するために調製された非生体材料を意味するものと理解される。例えば、微生物による変性又は破壊から本発明の活性化合物で保護することが意図されている工業材料は、接着剤、サイズ、紙、壁紙及び厚紙、織物、カーペット、皮革、木材、塗料及びプラスチック製品、冷却用潤滑油、並びに、微生物によって侵襲又は破壊され得る別の材料などであり得る。微生物の増殖により損なわれ得る建築物及び製造プラントの部品、例えば、冷却水循環路、冷却装置及び暖房装置、並びに、換気設備及空調設備なども、保護すべき材料の範囲内に包含される。本発明の範囲内にある工業材料としては、好ましくは、接着剤、サイズ、紙及び厚紙、皮革、木材、塗料、冷却用潤滑油及び熱媒液などを挙げることができ、さらに好ましくは、木材を挙げることができる。本発明に従う活性化合物又は組成物は、腐朽、腐敗、変色、脱色又は黴発生などの有害な影響を防止してもよい。さらに、本発明に従う化合物は、海水又は淡海水と接触するもの（特に、船体、障壁（ｓｃｒｅｅｎ）、網、建造物、係船設備及び信号システム）を付着物から保護するために使用することもできる。

【０１６９】
望ましくない菌類を防除するための本発明に従う方法は、貯蔵品を保護するために使用することもできる。ここで、貯蔵品は、長期間の保護が望まれる、植物若しくは動物起源の天然物質又は自然起源のそれら天然物質の加工製品を意味するものと理解される。植物起源の貯蔵品、例えば、植物若しくは植物の部分、例えば、茎、葉、塊茎、種子、果実、穀粒などは、新たに収穫されたものを保護することができるか、又は、（予備）乾燥、加湿、粉砕、摩砕、加圧成形若しくは焙焼によって加工された後で保護することができる。貯蔵品には、さらに、未加工の材木（例えば、建築用材木、電柱及び柵）又は完成品の形態にある材木（例えば、家具）の両方とも包含される。動物起源の貯蔵品は、例えば、皮革、革製品、毛皮及び獣毛などである。本発明に従う活性化合物は、腐朽、腐敗、変色、脱色又は黴発生などの有害な影響を防止してもよい。

【０１７０】
本発明に従って治療することが可能な菌類病の病原体の非限定的な例としては、以下のものを挙げることができる：

・　例えば以下のような、うどんこ病病原体に起因する病害：　ブルメリア属各種（Ｂｌｕｍｅｒｉａ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ブルメリア・グラミニス（Ｂｌｕｍｅｒｉａ　ｇｒａｍｉｎｉｓ）；　ポドスファエラ属各種（Ｐｏｄｏｓｐｈａｅｒａ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ポドスファエラ・レウコトリカ（Ｐｏｄｏｓｐｈａｅｒａ　ｌｅｕｃｏｔｒｉｃｈａ）；　スファエロテカ属各種（Ｓｐｈａｅｒｏｔｈｅｃａ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、スファエロテカ・フリギネア（Ｓｐｈａｅｒｏｔｈｅｃａ　ｆｕｌｉｇｉ

ｎｅａ）；　ウンシヌラ属各種（Ｕｎｃｉｎｕｌａ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ウンシヌラ・ネカトル（Ｕｎｃｉｎｕｌａ　ｎｅｃａｔｏｒ）；

・　例えば以下のような、さび病病原体に起因する病害：　ギムノスポランギウム属各種（Ｇｙｍｎｏｓｐｏｒａｎｇｉｕｍ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ギムノスポランギウム・サビナエ（Ｇｙｍｎｏｓｐｏｒａｎｇｉｕｍ　ｓａｂｉｎａｅ）；　ヘミレイア属各種（Ｈｅｍｉｌｅｉａ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ヘミレイア・バスタトリクス（Ｈｅｍｉｌｅｉａ　ｖａｓｔａｔｒｉｘ）；　ファコプソラ属各種（Ｐｈａｋｏｐｓｏｒａ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ファコプソラ・パキリジ（Ｐｈａｋｏｐｓｏｒａ　ｐａｃｈｙｒｈｉｚｉ）及びファコプソラ・メイボミアエ（Ｐｈａｋｏｐｓｏｒａ　ｍｅｉｂｏｍｉａｅ）；　プッシニア属各種（Ｐｕｃｃｉｎｉａ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、プッシニア・レコンジタ（Ｐｕｃｃｉｎｉａ　ｒｅｃｏｎｄｉｔａ）又はプッシニア・トリシチナ（Ｐｕｃｃｉｎｉａ　ｔｒｉｔｉｃｉｎａ）；　ウロミセス属各種（Ｕｒｏｍｙｃｅｓ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ウロミセス・アペンジクラツス（Ｕｒｏｍｙｃｅｓ　ａｐｐｅｎｄｉｃｕｌａｔｕｓ）；

・　例えば以下のような、卵菌類（Ｏｏｍｙｃｅｔｅｓ）の群の病原体に起因する病害：　ブレミア属各種（Ｂｒｅｍｉａ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ブレミア・ラクツカエ（Ｂｒｅｍｉａ　ｌａｃｔｕｃａｅ）；　ペロノスポラ属各種（Ｐｅｒｏｎｏｓｐｏｒａ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ペロノスポラ・ピシ（Ｐｅｒｏｎｏｓｐｏｒａ　ｐｉｓｉ）又はペロノスポラ・ブラシカエ（Ｐ．　ｂｒａｓｓｉｃａｅ）；　フィトフトラ属各種（Ｐｈｙｔｏｐｈｔｈｏｒａ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、フィトフトラ・インフェスタンス（Ｐｈｙｔｏｐｈｔｈｏｒａ　ｉｎｆｅｓｔａｎｓ）；　プラスモパラ属各種（Ｐｌａｓｍｏｐａｒａ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、プラスモパラ・ビチコラ（Ｐｌａｓｍｏｐａｒａ　ｖｉｔｉｃｏｌａ）；　シュードペロノスポラ属各種（Ｐｓｅｕｄｏｐｅｒｏｎｏｓｐｏｒａ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、シュードペロノスポラ・フムリ（Ｐｓｅｕｄｏｐｅｒｏｎｏｓｐｏｒａ　ｈｕｍｕｌｉ）又はシュードペロノスポラ・クベンシス（Ｐｓｅｕｄｏｐｅｒｏｎｏｓｐｏｒａ　ｃｕｂｅｎｓｉｓ）；　ピシウム属各種（Ｐｙｔｈｉｕｍ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ピシウム・ウルチムム（Ｐｙｔｈｉｕｍ　ｕｌｔｉｍｕｍ）；

・　例えば以下のものに起因する、斑点病（ｌｅａｆ　ｂｌｏｔｃｈ　ｄｉｓｅａｓｅ）及び萎凋病（ｌｅａｆ　ｗｉｌｔ　ｄｉｓｅａｓｅ）：　アルテルナリア属各種（Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、アルテルナリア・ソラニ（Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ　ｓｏｌａｎｉ）；　セルコスポラ属各種（Ｃｅｒｃｏｓｐｏｒａ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、セルコスポラ・ベチコラ（Ｃｅｒｃｏｓｐｏｒａ　ｂｅｔｉｃｏｌａ）；　クラジオスポリウム属各種（Ｃｌａｄｉｏｓｐｏｒｉｕｍ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、クラジオスポリウム・ククメリヌム（Ｃｌａｄｉｏｓｐｏｒｉｕｍ　ｃｕｃｕｍｅｒｉｎｕｍ）；　コクリオボルス属各種（Ｃｏｃｈｌｉｏｂｏｌｕｓ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、コクリオボルス・サチブス（Ｃｏｃｈｌｉｏｂｏｌｕｓ　ｓａｔｉｖｕｓ）（分生子形態：Ｄｒｅｃｈｓｌｅｒａ，　同義語：Ｈｅｌｍｉｎｔｈｏｓｐｏｒｉｕｍ）；　コレトトリクム属各種（Ｃｏｌｌｅｔｏｔｒｉｃｈｕｍ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、コレトトリクム・リンデムタニウム（Ｃｏｌｌｅｔｏｔｒｉｃｈｕｍ　ｌｉｎｄｅｍｕｔｈａｎｉｕｍ）；　シクロコニウム属各種（Ｃｙｃｌｏｃｏｎｉｕｍ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、シクロコニウム・オレアギヌム（Ｃｙｃｌｏｃｏｎｉｕｍ　ｏｌｅａｇｉｎｕｍ）；　ジアポルテ属各種（Ｄｉａｐｏｒｔｈｅ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ジアポルテ・シトリ（Ｄｉａｐｏｒｔｈｅ　ｃｉｔｒｉ）；　エルシノエ属各種（Ｅｌｓｉｎｏｅ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、エルシノエ・ファウセッチイ（Ｅｌｓｉｎｏｅ　ｆａｗｃｅｔｔｉｉ）；　グロエオスポリウム属各種（Ｇｌｏｅｏｓｐｏｒｉｕｍ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、グロエオスポリウム・ラエチコロル（Ｇｌｏｅｏｓｐｏｒｉｕｍ　ｌａｅｔｉｃｏｌｏｒ）；　グロメレラ属各種（Ｇｌｏｍｅｒｅｌｌａ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、グロメレラ・シングラタ（Ｇｌｏｍｅｒｅｌｌａ　ｃｉｎｇｕｌａｔａ）；　グイグナルジア属各種（Ｇｕｉｇｎａｒｄｉａ　ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、グイグナルジア・

ビドウェリ（Ｇｕｉｇｎａｒｄｉａ ｂｉｄｗｅｌｌｉ）； レプトスファエリア属各種（Ｌｅｐｔｏｓｐｈａｅｒｉａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、レプトスファエリア・マクランス（Ｌｅｐｔｏｓｐｈａｅｒｉａ ｍａｃｕｌａｎｓ）； マグナポルテ属各種（Ｍａｇｎａｐｏｒｔｈｅ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、マグナポルテ・グリセア（Ｍａｇｎａｐｏｒｔｈｅ ｇｒｉｓｅａ）； ミクロドキウム属各種（Ｍｉｃｒｏｄｏｃｈｉｕｍ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ミクロドキウム・ニバレ（Ｍｉｃｒｏｄｏｃｈｉｕｍ ｎｉｖａｌｅ）； ミコスファエレラ属各種（Ｍｙｃｏｓｐｈａｅｒｅｌｌａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ミコスファエレラ・グラミニコラ（Ｍｙｃｏｓｐｈａｅｒｅｌｌａ ｇｒａｍｉｎｉｃｏｌａ）及びミコスファエレラ・フィジエンシス（Ｍ． ｆｉｊｉｅｎｓｉｓ）； ファエオスファエリア属各種（Ｐｈａｅｏｓｐｈａｅｒｉａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ファエオスファエリア・ノドルム（Ｐｈａｅｏｓｐｈａｅｒｉａ ｎｏｄｏｒｕｍ）； ピレノホラ属各種（Ｐｙｒｅｎｏｐｈｏｒａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ピレノホラ・テレス（Ｐｙｒｅｎｏｐｈｏｒａ ｔｅｒｅｓ）； ラムラリア属各種（Ｒａｍｕｌａｒｉａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ラムラリア・コロ－シグニ（Ｒａｍｕｌａｒｉａ ｃｏｌｌｏ－ｃｙｇｎｉ）； リンコスポリウム属各種（Ｒｈｙｎｃｈｏｓｐｏｒｉｕｍ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、リンコスポリウム・セカリス（Ｒｈｙｎｃｈｏｓｐｏｒｉｕｍ ｓｅｃａｌｉｓ）； セプトリア属各種（Ｓｅｐｔｏｒｉａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、セプトリア・アピイ（Ｓｅｐｔｏｒｉａ ａｐｉｉ）； チフラ属各種（Ｔｙｐｈｕｌａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、チフラ・インカルナタ（Ｔｙｐｈｕｌａ ｉｎｃａｒｎａｔａ）； ベンツリア属各種（Ｖｅｎｔｕｒｉａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ベンツリア・イナエクアリス（Ｖｅｎｔｕｒｉａ ｉｎａｅｑｕａｌｉｓ）；

・ 例えば以下のものに起因する、根及び茎の病害： コルチシウム属各種（Ｃｏｒｔｉｃｉｕｍ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、コルチシウム・グラミネアルム（Ｃｏｒｔｉｃｉｕｍ ｇｒａｍｉｎｅａｒｕｍ）； フサリウム属各種（Ｆｕｓａｒｉｕｍ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、フサリウム・オキシスポルム（Ｆｕｓａｒｉｕｍ ｏｘｙｓｐｏｒｕｍ）； ガエウマンノミセス属各種（Ｇａｅｕｍａｎｎｏｍｙｃｅｓ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ガエウマンノミセス・グラミニス（Ｇａｅｕｍａｎｎｏｍｙｃｅｓ ｇｒａｍｉｎｉｓ）； リゾクトニア属各種（Ｒｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、リゾクトニア・ソラニ（Ｒｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ ｓｏｌａｎｉ）； タペシア属各種（Ｔａｐｅｓｉａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、タペシア・アクホルミス（Ｔａｐｅｓｉａ ａｃｕｆｏｒｍｉｓ）； チエラビオプシス属各種（Ｔｈｉｅｌａｖｉｏｐｓｉｓ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、チエラビオプシス・バシコラ（Ｔｈｉｅｌａｖｉｏｐｓｉｓ ｂａｓｉｃｏｌａ）；

・ 例えば以下のものに起因する、穂の病害（ｅａｒ ａｎｄ ｐａｎｉｃｌｅ ｄｉｓｅａｓｅ）（トウモロコシの穂軸を包含する）： アルテルナリア属各種（Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、アルテルナリア属種（Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ ｓｐｐ．）； アスペルギルス属各種（Ａｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、アスペルギルス・フラブス（Ａｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ ｆｌａｖｕｓ）； クラドスポリウム属各種（Ｃｌａｄｏｓｐｏｒｉｕｍ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、クラドスポリウム・クラドスポリオイデス（Ｃｌａｄｏｓｐｏｒｉｕｍ ｃｌａｄｏｓｐｏｒｉｏｉｄｅｓ）； クラビセプス属各種（Ｃｌａｖｉｃｅｐｓ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、クラビセプス・プルプレア（Ｃｌａｖｉｃｅｐｓ ｐｕｒｐｕｒｅａ）； フサリウム属各種（Ｆｕｓａｒｉｕｍ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、フサリウム・クルモルム（Ｆｕｓａｒｉｕｍ ｃｕｌｍｏｒｕｍ）； ジベレラ属各種（Ｇｉｂｂｅｒｅｌｌａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ジベレラ・ゼアエ（Ｇｉｂｂｅｒｅｌｌａ ｚｅａｅ）； モノグラフェラ属各種（Ｍｏｎｏｇｒａｐｈｅｌｌａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、モノグラフェラ・ニバリス（Ｍｏｎｏｇｒａｐｈｅｌｌａ ｎｉｖａｌｉｓ）； セプトリア属各種（Ｓｅｐｔｏｒｉａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、セプトリア・ノドルム（Ｓｅｐｔｏｒｉａ ｎｏｄｏｒｕｍ）；

・ 例えば以下のものなどの、黒穂病菌類（ｓｍｕｔ ｆｕｎｇｉ）に起因する病害：

スファセロテカ属各種（Ｓｐｈａｃｅｌｏｔｈｅｃａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、スファセロテカ・レイリアナ（Ｓｐｈａｃｅｌｏｔｈｅｃａ ｒｅｉｌｉａｎａ）； チレチア属各種（Ｔｉｌｌｅｔｉａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、チレチア・カリエス（Ｔｉｌｌｅｔｉａ ｃａｒｉｅｓ）、チレチア・コントロベルサ（Ｔ． ｃｏｎｔｒｏｖｅｒｓａ）； ウロシスチス属各種（Ｕｒｏｃｙｓｔｉｓ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ウロシスチス・オクルタ（Ｕｒｏｃｙｓｔｉｓ ｏｃｃｕｌｔａ）； ウスチラゴ属各種（Ｕｓｔｉｌａｇｏ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ウスチラゴ・ヌダ（Ｕｓｔｉｌａｇｏ ｎｕｄａ）、ウスチラゴ・ヌダ・トリシチ（Ｕ． ｎｕｄａ ｔｒｉｔｉｃｉ）；

・ 例えば以下のものに起因する、果実の腐敗（ｆｒｕｉｔ ｒｏｔ）： アスペルギルス属各種（Ａｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、アスペルギルス・フラブス（Ａｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ ｆｌａｖｕｓ）； ボトリチス属各種（Ｂｏｔｒｙｔｉｓ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ボトリチス・シネレア（Ｂｏｔｒｙｔｉｓ ｃｉｎｅｒｅａ）； ペニシリウム属各種（Ｐｅｎｉｃｉｌｌｉｕｍ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ペニシリウム・エクスパンスム（Ｐｅｎｉｃｉｌｌｉｕｍ ｅｘｐａｎｓｕｍ）及びペニシリウム・プルプロゲヌム（Ｐ． ｐｕｒｐｕｒｏｇｅｎｕｍ）； スクレロチニア属各種（Ｓｃｌｅｒｏｔｉｎｉａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、スクレロチニア・スクレロチオルム（Ｓｃｌｅｒｏｔｉｎｉａ ｓｃｌｅｒｏｔｉｏｒｕｍ）； ベルチシリウム属各種（Ｖｅｒｔｉｃｉｌｉｕｍ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ベルチシリウム・アルボアトルム（Ｖｅｒｔｉｃｉｌｉｕｍ ａｌｂｏａｔｒｕｍ）；

・ 例えば以下のものに起因する、種子及び土壌によって媒介される腐敗病及び萎凋病（ｓｅｅｄ－ ａｎｄ ｓｏｉｌ－ｂｏｒｎｅ ｒｏｔ ａｎｄ ｗｉｌｔ ｄｉｓｅａｓｅ）並びに実生の病害： フサリウム属各種（Ｆｕｓａｒｉｕｍ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、フサリウム・クルモルム（Ｆｕｓａｒｉｕｍ ｃｕｌｍｏｒｕｍ）； フィトフトラ属各種（Ｐｈｙｔｏｐｈｔｈｏｒａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、フィトフトラ・カクトルム（Ｐｈｙｔｏｐｈｔｈｏｒａ ｃａｃｔｏｒｕｍ）； ピシウム属各種（Ｐｙｔｈｉｕｍ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ピシウム・ウルチムム（Ｐｙｔｈｉｕｍ ｕｌｔｉｍｕｍ）； リゾクトニア属各種（Ｒｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、リゾクトニア・ソラニ（Ｒｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ ｓｏｌａｎｉ）； スクレロチウム属各種（Ｓｃｌｅｒｏｔｉｕｍ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、スクレロチウム・ロルフシイ（Ｓｃｌｅｒｏｔｉｕｍ ｒｏｌｆｓｉｉ）；

・ 例えば以下のものに起因する、癌性病害（ｃａｎｃｅｒ）、こぶ（ｇａｌｌ）及び天狗巣病（ｗｉｔｃｈｅｓ’ ｂｒｏｏｍ）： ネクトリア属各種（Ｎｅｃｔｒｉａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ネクトリア・ガリゲナ（Ｎｅｃｔｒｉａ ｇａｌｌｉｇｅｎａ）；

・ 例えば以下のものに起因する、萎凋病（ｗｉｌｔ ｄｉｓｅａｓｅ）： モニリニア属各種（Ｍｏｎｉｌｉｎｉａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、モニリニア・ラキサ（Ｍｏｎｉｌｉｎｉａ ｌａｘａ）；

・ 例えば以下のものに起因する、葉、花及び果実の奇形： タフリナ属各種（Ｔａｐｈｒｉｎａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、タフリナ・デホルマンス（Ｔａｐｈｒｉｎａ ｄｅｆｏｒｍａｎｓ）；

・ 例えば以下のものに起因する、木本植物の衰退性病害（ｄｅｇｅｎｅｒａｔｉｖｅ ｄｉｓｅａｓｅ）： エスカ属各種（Ｅｓｃａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ファエモニエラ・クラミドスポラ（Ｐｈａｅｍｏｎｉｅｌｌａ ｃｈｌａｍｙｄｏｓｐｏｒａ）及びファエオアクレモニウム・アレオフィルム（Ｐｈａｅｏａｃｒｅｍｏｎｉｕｍ ａｌｅｏｐｈｉｌｕｍ）及びフォミチポリア・メジテラネア（Ｆｏｍｉｔｉｐｏｒｉａ ｍｅｄｉｔｅｒｒａｎｅａ；

・ 例えば以下のものに起因する、花及び種子の病害： ボトリチス属各種（Ｂｏｔｒｙｔｉｓ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ボトリチス・シネレア（Ｂｏｔｒｙｔｉｓ ｃｉｎｅｒｅａ）；

・ 例えば以下のものに起因する、植物塊茎の病害： リゾクトニア属各種（Ｒｈｉｚ

octonia species）、例えば、リゾクトニア・ソラニ（Rhizoctonia solani）； ヘルミントスポリウム属各種（Helminthosporium species）、例えば、ヘルミントスポリウム・ソラニ（Helminthosporium solani）；

・ 例えば以下のものなどの、細菌性病原体に起因する病害： キサントモナス属各種（Xanthomonas species）、例えば、キサントモナス・カムペストリス pv.オリザエ（Xanthomonas campestris pv. oryzae）； シュードモナス属各種（Pseudomonas species）、例えば、シュードモナス・シリンガエ pv.ラクリマンス（Pseudomonas syringae pv. lachrymans）； エルビニア属各種（Erwinia species）、例えば、エルビニア・アミロボラ（Erwinia amylovora）。

【０１７１】

ダイズの以下の病害を好ましくは防除することができる：

・ 例えば以下のものに起因する、葉、茎、鞘及び種子の菌類病：
アルテルナリア斑点病（Alternaria leaf spot）（Alternaria spec. atrans tenuissima）、炭疽病（Colletotrichum gloeosporoides dematium var. truncatum）、褐紋病（brown spot）（Septoria glycines）、紫斑病（cercospora leaf spot and blight）（Cercospora kikuchii）、コアネホラ葉枯病（choanephora leaf blight）（Choanephora infundibulifera trispora（Syn.））、ダクツリオホラ斑点病（dactuliophora leaf spot）（Dactuliophora glycines）、べと病（Peronospora manshurica）、ドレクスレラ胴枯病（drechslera blight）（Drechslera glycini）、斑点病（frogeye leaf spot）（Cercospora sojina）、そばかす病（leptosphaerulina leaf spot）（Leptosphaerulina trifolii）、灰星病（phyllostica leaf spot）（Phyllosticta sojaecola）、黒点病（pod and stem blight）（Phomopsis sojae）、うどんこ病（Microsphaera diffusa）、ピレノカエタ斑点病（pyrenochaeta leaf spot）（Pyrenochaeta glycines）、葉腐病（rhizoctonia aerial, foliage, and web blight）（Rhizoctonia solani）、さび病（Phakopsora pachyrhizi, Phakopsora meibomiae）、黒とう病（Sphaceloma glycines）、ステムフィリウム葉枯病（stemphylium leaf blight）（Stemphylium botryosum）、褐色輪紋病（Corynespora cassiicola）；

・ 例えば以下のものに起因する、根及び茎基部の菌類病：
黒根腐病（Calonectria crotalariae）、炭腐病（Macrophomina phaseolina）、赤かび病（fusarium blight or wilt, root rot, and pod and collar rot）（Fusarium oxysporum、Fusarium orthoceras、Fusarium semitectum、Fusarium equiseti）、ミコレプトジスクス根腐病（mycoleptodiscus root rot）（Mycoleptodiscus terrestris）、根腐病（neocosmospora）（Neocosmopspora vasinfecta）、黒点病（Diaporthe phaseolorum）、茎腐爛病（stem canker）（Diaporthe phaseolorum var. caulivora）、茎疫病

（ｐｈｙｔｏｐｈｔｈｏｒａ ｒｏｔ）（Ｐｈｙｔｏｐｈｔｈｏｒａ ｍｅｇａｓｐｅｒｍａ）、落葉病（ｂｒｏｗｎ ｓｔｅｍ ｒｏｔ）（Ｐｈｉａｌｏｐｈｏｒａ ｇｒｅｇａｔａ）、根茎腐敗病（ｐｙｔｈｉｕｍ ｒｏｔ）（Ｐｙｔｈｉｕｍ ａｐｈａｎｉｄｅｒｍａｔｕｍ、Ｐｙｔｈｉｕｍ ｉｒｒｅｇｕｌａｒｅ、Ｐｙｔｈｉｕｍ ｄｅｂａｒｙａｎｕｍ、Ｐｙｔｈｉｕｍ ｍｙｒｉｏｔｙｌｕｍ、Ｐｙｔｈｉｕｍ ｕｌｔｉｍｕｍ）、リゾクトニア根腐病（ｒｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ ｒｏｏｔ ｒｏｔ, ｓｔｅｍ ｄｅｃａｙ, ａｎｄ ｄａｍｐｉｎｇ－ｏｆｆ）（Ｒｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ ｓｏｌａｎｉ）、菌核病（ｓｃｌｅｒｏｔｉｎｉａ ｓｔｅｍ ｄｅｃａｙ）（Ｓｃｌｅｒｏｔｉｎｉａ ｓｃｌｅｒｏｔｉｏｒｕｍ）、スクレロチニアサウザンブライト病（ｓｃｌｅｒｏｔｉｎｉａ ｓｏｕｔｈｅｒｎ ｂｌｉｇｈｔ）（Ｓｃｌｅｒｏｔｉｎｉａ ｒｏｌｆｓｉｉ）、チエラビオプシス根腐病（ｔｈｉｅｌａｖｉｏｐｓｉｓ ｒｏｏｔ ｒｏｔ）（Ｔｈｉｅｌａｖｉｏｐｓｉｓ ｂａｓｉｃｏｌａ）。

【０１７２】

工業材料を劣化又は変性させることができる微生物としては、例えば、細菌類、菌類、酵母類、藻類及び粘菌類（ｓｌｉｍｅ ｏｒｇａｎｉｓｍｓ）などを挙げることができる。本発明に従う活性化合物は、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（ｓｌｉｍｅ ｏｒｇａｎｉｓｍｓ）及び藻類に対して作用する。その例としては、以下の属の微生物を挙げることができる： アルテルナリア（Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ）、例えば、アルテルナリア・テヌイス（Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ ｔｅｎｕｉｓ）； アスペルギルス（Ａｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ）、例えば、アスペルギルス・ニゲル（Ａｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ ｎｉｇｅｒ）； カエトミウム（Ｃｈａｅｔｏｍｉｕｍ）、例えば、カエトミウム・グロボスム（Ｃｈａｅｔｏｍｉｕｍ ｇｌｏｂｏｓｕｍ）； コニオホラ（Ｃｏｎｉｏｐｈｏｒａ）、例えば、コニオホラ・プエタナ（Ｃｏｎｉｏｐｈｏｒａ ｐｕｅｔａｎａ）； レンチヌス（Ｌｅｎｔｉｎｕｓ）、例えば、レンチヌス・チグリヌス（Ｌｅｎｔｉｎｕｓ ｔｉｇｒｉｎｕｓ）； ペニシリウム（Ｐｅｎｉｃｉｌｌｉｕｍ）、例えば、ペニシリウム・グラウクム（Ｐｅｎｉｃｉｌｌｉｕｍ ｇｌａｕｃｕｍ）； ポリポルス（Ｐｏｌｙｐｏｒｕｓ）、例えば、ポリポルス・ベルシコロル（Ｐｏｌｙｐｏｒｕｓ ｖｅｒｓｉｃｏｌｏｒ）； アウレオバシジウム（Ａｕｒｅｏｂａｓｉｄｉｕｍ）、例えば、アウレオバシジウム・プルランス（Ａｕｒｅｏｂａｓｉｄｉｕｍ ｐｕｌｌｕｌａｎｓ）； スクレロホマ（Ｓｃｌｅｒｏｐｈｏｍａ）、例えば、スクレロホマ・ピチオフィラ（Ｓｃｌｅｒｏｐｈｏｍａ ｐｉｔｙｏｐｈｉｌａ）； トリコデルマ（Ｔｒｉｃｈｏｄｅｒｍａ）、例えば、トリコデルマ・ビリデ（Ｔｒｉｃｈｏｄｅｒｍａ ｖｉｒｉｄｅ）； エシェリキア（Ｅｓｃｈｅｒｉｃｈｉａ）、例えば、エシェリキア・コリ（Ｅｓｃｈｅｒｉｃｈｉａ ｃｏｌｉ）； シュードモナス（Ｐｓｅｕｄｏｍｏｎａｓ）、例えば、シュードモナス・アエルギノサ（Ｐｓｅｕｄｏｍｏｎａｓ ａｅｒｕｇｉｎｏｓａ）； スタフィロコッカス（Ｓｔａｐｈｙｌｏｃｏｃｃｕｓ）、例えば、スタフィロコッカス・アウレウス（Ｓｔａｐｈｙｌｏｃｏｃｃｕｓ ａｕｒｅｕｓ）。

【０１７３】

さらに、本発明に従う活性化合物は、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、カンジダ属各種（Ｃａｎｄｉｄａ ｓｐｅｃｉｅｓ）、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）に対して〕、並びに、エピデルモフィトン・フロコスム（Ｅｐｉｄｅｒｍｏｐｈｙｔｏｎ ｆｌｏｃｃｏｓｕｍ）、アスペルギルス属各種（Ａｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、アスペルギルス・ニゲル（Ａｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ ｎｉｇｅｒ）及びアスペルギルス・フミガツス（Ａｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ ｆｕｍｉｇａｔｕｓ）、トリコフィトン属各種（Ｔｒｉｃｈｏｐｈｙｔｏｎ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、トリコフィトン・メンタグロフィテス（Ｔｒｉｃｈｏｐｈｙｔｏｎ ｍｅｎｔａｇｒｏｐｈｙｔｅｓ）、ミクロスポロン属各種（Ｍｉｃｒｏ

ｓｐｏｒｏｎ ｓｐｅｃｉｅｓ）、例えば、ミクロスポロン・カニス（Ｍｉｃｒｏｓｐｏｒｏｎ ｃａｎｉｓ）及びミクロスポロン・アウドウイニイ（Ｍｉｃｒｏｓｐｏｒｏｎ ａｕｄｏｕｉｎｉｉ）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、包含される真菌スペクトルを決して制限するものではなく、単に例示的な性質のものである。

【０１７４】

従って、本発明に従う活性化合物は、医薬用途と非医薬用途の両方で使用することができる。

【０１７５】

本発明の活性化合物を殺菌剤として使用する場合、その施用量は、施用の種類に応じて、比較的広い範囲内で変えることができる。本発明に従う活性化合物の施用量は、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： ０．１～１００００ｇ／ｈａ、好ましくは、１０～１０００ｇ／ｈａ、さらに好ましくは、５０～３００ｇ／ｈａ（灌水又は滴下によって施用する場合、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には、上記施用量はさらに低減させることができる）；

・ 種子を処理する場合： 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、さらに一層好ましくは、種子１００ｋｇ当たり２．５～１２．５ｇ；

・ 土壌処理の場合： ０．１～１００００ｇ／ｈａ、好ましくは、１～５０００ｇ／ｈａ。

【０１７６】

上記施用量は、単に例としてのものであり、本発明の目的に関して限定するものではない。

【０１７７】

本発明に従う活性化合物又は組成物は、かくして、処理後ある一定の期間、上記病原体による攻撃から植物を保護するために用いることができる。保護がもたらされる期間は、植物が該活性化合物で処理されてから、一般に、１～２８日間、好ましくは、１～１４日間、特に好ましくは、１～１０日間、極めて特に好ましくは、１～７日間に及び、又は、種子処理後、最大で２００日間に及ぶ。

【０１７８】

さらに、本発明の処理によって、収穫物並びにその収穫作物から作られる食料及び飼料におけるマイコトキシンの含有量を低減させることが可能である。マイコトキシンとしては、限定するものではないが、特に、以下のものを挙げることができる：デオキシニバレノール（ＤＯＮ）、ニバレノール、１５－Ａｃ－ＤＯＮ、３－Ａｃ－ＤＯＮ、Ｔ２－トキシン、ＨＴ２－トキシン、フモニシン類、ゼアラレノン、モニリホルミン、フザリン、ジアセトキシシルペノール（ＤＡＳ）、ベアウベリシン（ｂｅａｕｖｅｒｉｃｉｎ）、エンニアチン、フサロプロリフェリン（ｆｕｓａｒｏｐｒｏｌｉｆｅｒｉｎ）、フサレノール（ｆｕｓａｒｅｎｏｌ）、オクラトキシン類、パツリン、エルゴットアルカロイド類及びアフラトキシン類〔これらは、例えば、以下の菌類によって産生され得る：とりわけ、フサリウム属各種（Ｆｕｓａｒｉｕｍ ｓｐｅｃ．）、例えば、フサリウム・アクミナツム（Ｆｕｓａｒｉｕｍ ａｃｕｍｉｎａｔｕｍ）、フサリウム・アベナセウム（Ｆ． ａｖｅｎａｃｅｕｍ）、フサリウム・クロオクウェレンセ（Ｆ． ｃｒｏｏｋｗｅｌｌｅｎｓｅ）、フサリウム・クルモルム（Ｆ． ｃｕｌｍｏｒｕｍ）、フサリウム・グラミネアルム（Ｆ． ｇｒａｍｉｎｅａｒｕｍ）（ジベレラ・ゼアエ（Ｇｉｂｂｅｒｅｌｌａ ｚｅａｅ））、フサリウム・エクイセチ（Ｆ． ｅｑｕｉｓｅｔｉ）、フサリウム・フジコロイ（Ｆ． ｆｕｊｉｋｏｒｏｉ）、フサリウム・ムサルム（Ｆ． ｍｕｓａｒｕｍ）、フサリウム・オキシスポルム（Ｆ． ｏｘｙｓｐｏｒｕｍ）、フサリウム・プロリフェラツム（Ｆ． ｐｒｏｌｉｆｅｒａｔｕｍ）、フサリウム・ポアエ（Ｆ． ｐｏａｅ）、フサリウム・シュードグラミネアルム（Ｆ． ｐｓｅｕｄｏｇｒａｍｉｎｅａｒｕｍ）、フサ

リウム・サムブシヌム（Ｆ．　ｓａｍｂｕｃｉｎｕｍ）、フサリウム・シルピ（Ｆ．　ｓｃｉｒｐｉ）、フサリウム・セミテクツム（Ｆ．　ｓｅｍｉｔｅｃｔｕｍ）、フサリウム・ソラニ（Ｆ．　ｓｏｌａｎｉ）、フサリウム・スポロトリコイデス（Ｆ．　ｓｐｏｒｏｔｒｉｃｈｏｉｄｅｓ）、フサリウム・ラングセチアエ（Ｆ．　ｌａｎｇｓｅｔｈｉａｅ）、フサリウム・スブグルチナンス（Ｆ．　ｓｕｂｇｌｕｔｉｎａｎｓ）、フサリウム・トリシンクツム（Ｆ．　ｔｒｉｃｉｎｃｔｕｍ）、フサリウム・ベルチシリオイデス（Ｆ．　ｖｅｒｔｉｃｉｌｌｉｏｉｄｅｓ）など、及び、さらに、とりわけ、アスペルギルス属各種（Ａｓｐｅｒｇｉｌｌｕｓ　ｓｐｅｃ．）、ペニシリウム属各種（Ｐｅｎｉｃｉｌｌｉｕｍ　ｓｐｅｃ．）、クラビセプス・プルプレア（Ｃｌａｖｉｃｅｐｓ　ｐｕｒｐｕｒｅａ）、スタキボトリス属各種（Ｓｔａｃｈｙｂｏｔｒｙｓ　ｓｐｅｃ．）など〕。

【０１７９】

適切な場合には、本発明の化合物は、特定の濃度又は特定の施用量において、除草剤、薬害軽減剤、成長調節剤若しくは植物の特性を改善する作用剤として、或いは、殺微生物剤（ｍｉｃｒｏｂｉｃｉｄｅ）として、例えば、殺菌剤（ｆｕｎｇｉｃｉｄｅ）、抗真菌剤（ａｎｔｉｍｙｃｏｔｉｃ）、殺細菌剤若しくは殺ウイルス剤（これは、ウイロイドに対する作用剤も包含する）として、或いは、ＭＬＯ（マイコプラズマ様生物）及びＲＬＯ（リケッチア様生物）に対する作用剤としても使用し得る。適切な場合には、それらは、別の活性化合物を合成するための中間体又は前駆物質としても使用することができる。

【０１８０】

本発明に従う活性化合物は、植物の代謝に干渉し、従って、成長調節剤として使用することも可能である。

【０１８１】

植物成長調節剤は、植物に対してさまざまな効果を及ぼし得る。該化合物の効果は、本質的に、植物の成育段階に基づいた施用の時期、及び、さらに、植物又はそれらの環境に対して施用される活性化合物の量、並びに、施用のタイプに依存する。何れの場合にも、成長調節剤は、作物植物に対して特定の望ましい効果を有しているべきである。

【０１８２】

植物の成長を調節する化合物は、例えば、植物の栄養成長を阻害するために使用することができる。成長に対するそのような阻害は、例えば芝生の場合、観賞用庭園、公園及びスポーツ施設において、路傍において、空港において、又は、果樹園において、芝生を刈り込む頻度を低減することが可能であるので、経済的に興味深い。さらにまた、路傍において、及び、パイプライン若しくは高架線の周辺において、又は、極めて一般的には、植物の力強い成長が望まれない区域において、草本植物及び木本植物の成長を抑制することも重要である。

【０１８３】

禾穀類の縦成長を阻害するために成長調節剤を使用することも重要である。これにより、収穫前に植物が倒伏するリスクが低減されるか又は完全に排除される。さらに、禾穀類の場合における成長調節剤は、稈を強化すること可能であり、倒伏に対しても対抗する。稈を短くし且つ強化するために成長調節剤を使用することによって、禾穀類作物が倒伏するリスクを伴うことなく、収量を増大させるためにそれまでよりも多い量の肥料を施用することが可能となる。

【０１８４】

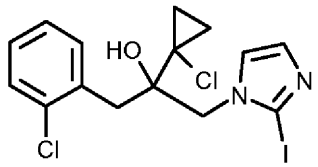
多くの種類の作物植物において、栄養成長を抑制することによってより密集した植え付けが可能となり、従って、土壌の表面に基づき、より高い収穫量を達成することが可能である。このようにして得られる矮小な植物の別の有利点は、作物の栽培及び収穫がより容易であるということである。

【０１８５】

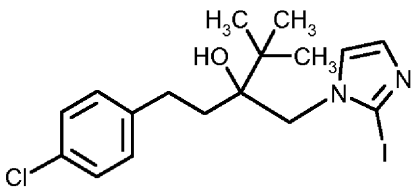
植物の栄養成長を阻害することにより、栄養素及び同化産物が植物の茎葉や根などの栄養部分（ｖｅｇｅｔａｔｉｖｅ　ｐａｒｔ）に対してよりも花及び果実の形成に対して多く利用されるので、収量も増大し得る。

【０１８６】
しばしば、成長調節剤は、栄養成長を促進するためにも使用され得る。このことは、植物の茎葉部を収穫する場合、極めて有益である。しかしながら、栄養成長を促進することにより、より多くの同化産物が形成され、その結果、より多くの又はより大きな果実が形成されるので、生殖成長も促進され得る。
【０１８７】
場合によっては、収量の増大は、栄養成長における検出可能な変化を伴うことなく、植物の代謝を操作することによって達成され得る。さらに、成長調節剤を使用して植物の組成を変えることが可能であり、植物の組成が変えられると、結果として、収穫された生成物の質が改善され得る。例えば、テンサイ、サトウキビ、パイナップルの糖度を高めることが可能であり、柑橘類果実の糖度を高めることが可能であり、又は、ダイズ若しくは穀類のタンパク質含有量を高めることが可能である。さらに、例えば、成長調節剤を用いて、収穫前又は収穫後に、望ましい成分（例えば、テンサイ又はサトウキビにおける糖分）の劣化を抑制することも可能である。さらに、植物の第２の成分の産生又は排除に対して積極的に影響を及ぼすことも可能である。１つの例は、ゴムの木におけるラテックスの流れに対する刺激である。
【０１８８】
成長調節剤の影響下において、単為結果果実が形成され得る。さらに、花の性別に影響を及ぼすことも可能であり得る。不稔花粉を産生することも可能であり、これは、育種において、及び、交雑種子の産生において、極めて重要である。
【０１８９】
成長調節剤を使用することにより、植物の分枝を制御することができる。一方では、頂芽優性を乱すことにより、側枝の発育を促進することが可能であり、これは、成長の抑制との組合せにおいても、特に観賞植物の栽培において、極めて望ましいであろう。しかしながら、他方では、側枝の成長を抑制することも可能である。この効果は、例えば、タバコの栽培において、又は、トマトの栽培において、特に興味深い。
【０１９０】
成長調節剤の影響下において、望ましい時点において植物の落葉が達成されるように、植物の葉の量を制御することが可能である。そのような落葉は、ワタの機械収穫において重要な役割を果たすが、同様に、別の作物（例えば、ブドウ栽培）における収穫を容易なものとするためにも興味深い。植物の落葉は、植物を移植する前にその植物の蒸散作用を低下させるためにも実施することができる。
【０１９１】
成長調節剤は、さらに、果実の裂開を調節するために使用することも可能である。一方では、果実の時期尚早の裂開を防止することが可能である。他方では、果実の裂開を促進することも可能であるか、又は、交替（ａｌｔｅｒｎａｔｉｏｎ）を排除するために、望ましい集団（「間引き」）を達成するために花の成育不良（ｆｌｏｗｅｒ　ａｂｏｒｔｉｏｎ）を促進することさえ可能である。交替（ａｌｔｅｒｎａｔｉｏｎ）は、内生的な理由で毎年収穫量が大きく変動する、一部の果実種の特徴を意味するものと理解される。最後に、機械収穫を可能とするか、又は、手作業による収穫を容易なものとするために、収穫時に成長調節剤を使用して果実を切り離すのに必要とされる力を低減させることができる。
【０１９２】
成長調節剤は、さらに、収穫前又は収穫後に、収穫物の熟成を早めるために又は遅くするために使用することも可能である。このことは、市場の要求に対して最適に適合させることを可能とするので、特に有利である。さらに、成長調節剤は、場合によっては、果実の色合いを改善し得る。さらに、成長調節剤は、特定の期間内に成熟を集中させるために使用することも可能である。これによって、例えば、タバコ、トマト又はコーヒーなどの場合において、機械的な又は手作業による単一操作での完全な収穫のための必要条件が確立される。

【０１９３】
成長調節剤を使用することによって、さらに、植物の種子又は芽の休眠に影響を及ぼすことも可能であり、その結果、植物（例えば、苗畑におけるパイナップル又は観賞植物など）は、例えば、通常であればそのようなことはない時点において、発芽するか、萌芽するか、又は、開花する。霜のリスクがある地域においては、晩霜に起因する損傷を回避するために、成長調節剤を用いて芽生え又は種子の発芽を遅延させることは望ましいであろう。
【０１９４】
最後に、成長調節剤は、霜、渇水又は土壌の高塩分に対する植物の抵抗性を誘発し得る。これによって、通常であれば植物の栽培には適さない地域において植物を栽培することが可能となる。
【０１９５】
上記で挙げられている植物は、一般式（Ｉ）で表される化合物及び／又は本発明に従う組成物を用いて、本発明に従って特に有利に処理することができる。該活性化合物又は組成物に関して上記で示されている好ましい範囲は、これら植物の処理にも当てはまる。特に重要なのは、本明細書中において具体的に挙げられている化合物又は組成物を用いた植物の処理である。
【０１９６】
下記実施例によって、本発明について例証する。しかしながら、本発明は、それら実施例に限定されない。
【実施例】
【０１９７】
調製実施例：
化合物Ｎｏ．１の調製
【０１９８】
【化８】



２－（２－クロロベンジル）－２－（１－クロロシクロプロピル）オキシラン（５００ｍｇ）と２－ヨード－１Ｈ－イミダゾール（４７９ｍｇ）をジメチルホルムアミド（５ｍＬ）に溶解させた溶液に、室温で、炭酸セシウム（８０４ｍｇ）を添加した。その混合物を５０℃で一晩撹拌し、次いで、水を添加した。その水相を除去し、酢酸エチルで抽出した。その有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下で濃縮した。その残渣をクロマトグラフィーで精製した。これにより、２－（１－クロロシクロプロピル）－１－（２－クロロフェニル）－３－（２－ヨード－１Ｈ－イミダゾール－１－イル）プロパン－２－オール（４７９ｍｇ）が得られた。
【０１９９】
化合物４の調製
【０２００】
【化９】



１０ｍＬのテトラヒドロフランに溶解させた７６７ｍｇ（２．５０ｍｍｏｌ）の１－（

４－クロロフェニル）－３－（１Ｈ－イミダゾール－１－イルメチル）－４，４－ジメチルペンタン－３－オールに、アルゴン雰囲気下、－７８℃で、３．４４ｍＬ（１．６Ｍ、５．５０ｍｍｏｌ）のｎ－ブチルリチウムを添加し、その反応混合物を０℃で０．５時間撹拌した。次いで、その混合物を－７８℃まで冷却した後、２．５ｍＬのテトラヒドロフランに溶解させた６９８ｍｇ（２．７５ｍｍｏｌ）のヨウ素を滴下して加え、その反応混合物を室温で一晩加熱した。翌朝、この温度で、炭酸ナトリウム飽和溶液を添加し、その反応混合物を酢酸エチルで抽出した。その有機相を合して硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、濃縮した。次いで、その粗製生成物をカラムクロマトグラフィー（シクロヘキサン／酢酸エチル　１：１）で予備精製し、その後、分取ＨＰＬＣで精製した。これにより、２７０ｍｇ（２４．８％）の所望生成物が得られた。

【０２０１】

化合物１、２、３、５及び１８は、類似した方法で得られる。

【０２０２】

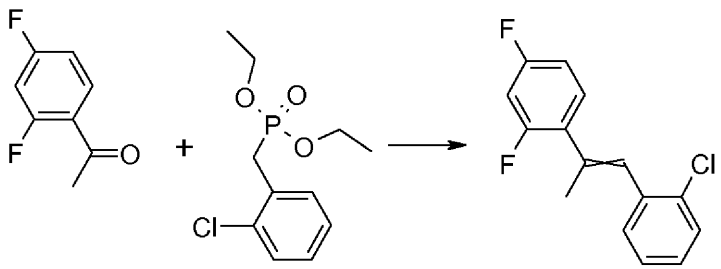
化合物１２、１３及び１４の調製

段階１

１－［１－（２－クロロフェニル）プロパ－１－エン－２－イル］－２，４－ジフルオロベンゼンの調製

【０２０３】

【化１０】



水素化ナトリウム（鉱油中６０重量％懸濁液、３６５ｍｇ、９．１３ｍｍｏｌ；新たに乾燥ヘプタンで洗浄したもの）を乾燥ＤＭＦ（２０ｍＬ）に懸濁させた懸濁液を撹拌しながら、それに、３℃で、２－クロロベンジルホスホン酸ジエチル（２．００ｇ、７．６１ｍｍｏｌ）を乾燥ＤＭＦ（３０ｍＬ）に溶解させた溶液を添加した。３℃で１時間撹拌した後、２’，４’－ジフルオロアセトフェノン（１．３１ｇ、８．３７ｍｍｏｌ）を乾燥ＤＭＦ（２０ｍＬ）に溶解させた溶液を滴下して加えた。得られた混合物を室温で６８時間撹拌し、次いで、水で希釈し、ジエチルエーテルで抽出した。その有機相を脱水し、減圧下で濃縮乾固させた。その残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製した。これにより、１－［１－（２－クロロフェニル）プロパ－１－エン－２－イル］－２，４－ジフルオロベンゼンがジアステレオ異性体の９３／７混合物［無色の固体、５６０ｍｇ、収率２６％；ＧＣ／ＭＳ：ｍ／ｚ＝２６４（$M^{+\cdot}$）；ＨＰＬＣ／ＭＳ：ｌｏｇＰ（ＨＣＯＯＨ）＝５．０５（主要なジアステレオ異性体）、５．３４（少量のジアステレオ異性体）］として得られた。

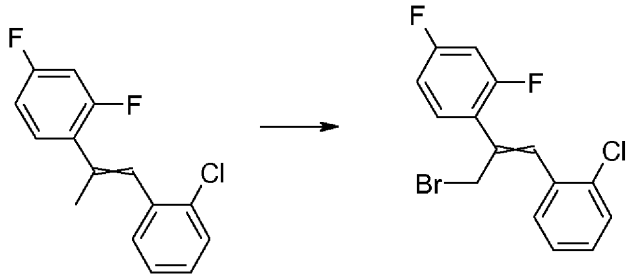
【０２０４】

段階２

１－［３－ブロモ－１－（２－クロロフェニル）プロパ－１－エン－２－イル］－２，４－ジフルオロベンゼンの調製

【０２０５】

【化１１】



１－［１－（２－クロロフェニル）プロパ－１－エン－２－イル］－２，４－ジフルオロベンゼン（６８０ｍｇ、２．５６ｍｍｏｌ）とＮ－ブロモスクシンイミド（８２３ｍｇ、４．６２ｍｍｏｌ）と過酸化ベンゾイル（３０ｍｇ）との、撹拌したＡｃＯＥｔ（１５ｍＬ）溶液を、３時間加熱還流した。室温まで冷却した後、その反応混合物をＡｃＯＥｔで希釈し、水で洗浄した。その有機相を合して脱水し、減圧下で濃縮乾固させた。シリカゲルクロマトグラフィーで精製して、１－［３－ブロモ－１－（２－クロロフェニル）プロパ－１－エン－２－イル］－２，４－ジフルオロベンゼンをジアステレオ異性体の５２／４８混合物［無色の油状物、７９２ｍｇ、収率８５％；ＧＣ／ＭＳ：ｍ／ｚ＝３４４（$M^{+\cdot}$）；ＨＰＬＣ／ＭＳ：ｌｏｇＰ$_{(HCOOH)}$＝４．８０（主要なジアステレオ異性体）、５．２５（少量のジアステレオ異性体）］として得た。

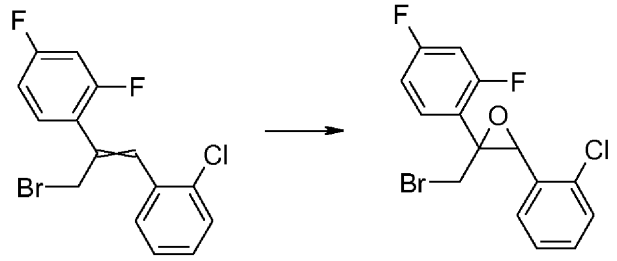
【０２０６】

段階３

２－（ブロモメチル）－３－（２－クロロフェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）オキシランの調製

【０２０７】

【化１２】



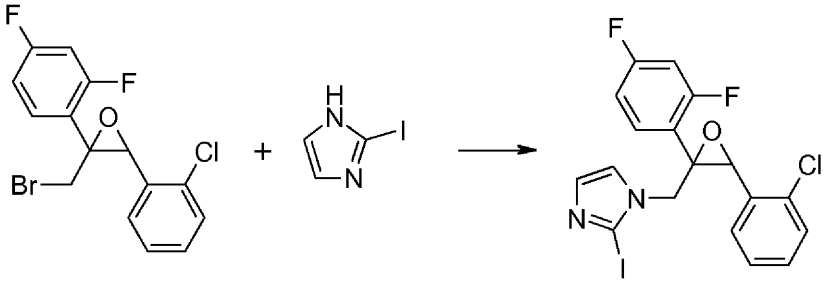
１－［３－ブロモ－１－（２－クロロフェニル）プロパ－１－エン－２－イル］－２，４－ジフルオロベンゼン（７２０ｍｇ、２．０９ｍｍｏｌ）の撹拌した酢酸（２０ｍＬ）溶液に、無水マレイン酸（２．０５ｇ、２０．９ｍｍｏｌ）、次いで、過酸化水素（３５重量％強度の溶液、２．０４ｇ、２０．９ｍｍｏｌ）を添加した。その反応混合物を４０℃で２４時間撹拌し、次いで、追加の過酸化水素（３５重量％強度の溶液、２．０４ｇ、２０．９ｍｍｏｌ）を添加した。反応混合物を２０℃で６６時間撹拌した。飽和水性チオ硫酸ナトリウムを添加することにより、過剰の酸化剤をクエンチした。その混合物をジクロロメタンで抽出し、有機相を$MgSO_4$で脱水し、減圧下で濃縮した。その残渣をシリカゲルで精製して、２－（ブロモメチル）－３－（２－クロロフェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）オキシランをジアステレオ異性体の５９／４１混合物［３１６ｍｇ、無色の油状物、収率４０％；ＧＣ／ＭＳ：ｍ／ｚ＝２７９（$[M-Br]^{+\cdot}$）；ＨＰＬＣ／ＭＳ：ｌｏｇＰ$_{(HCOOH)}$＝４．６１（主要なジアステレオ異性体）、５．００（少量のジアステレオ異性体）］として得た。

【０２０８】

段階４

１－｛［３－（２－クロロフェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）オキシラン－２－イル］メチル｝－２－ヨード－１Ｈ－イミダゾールの調製

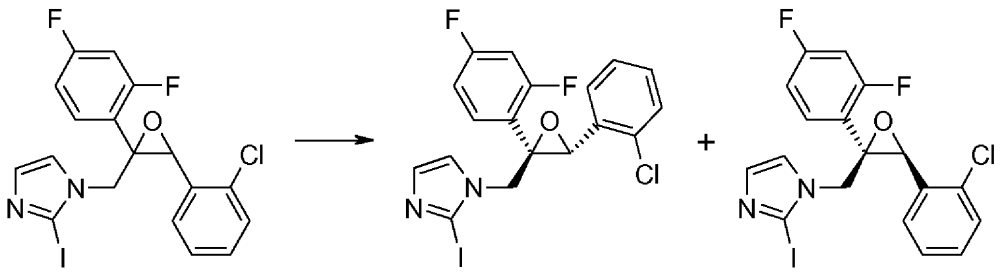
【０２０９】
【化１３】



２－ヨードイミダゾール（２４２ｍｇ、１．２５ｍｍｏｌ）の、撹拌した乾燥ＤＭＦ（８ｍＬ）溶液に、３℃で、水素化ナトリウム（鉱油中６０重量％強度分散液、５６．７ｍｇ、１．４１ｍｍｏｌ）を添加した。その反応混合物を室温で２０分間撹拌し、次いで、乾燥ＤＭＦ（４ｍＬ）中の２－（ブロモメチル）－３－（２－クロロフェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）オキシラン（３００ｍｇ、０．８３ｍｍｏｌ）を添加した。得られた混合物を５０℃で２０時間撹拌し、次いで、８０℃で３時間撹拌した。室温まで冷却した後、その反応混合物を水で希釈し、ＡｃＯＥｔで抽出した。その抽出物を脱水し、減圧下で濃縮乾固させた。その濾液を合し、減圧下で濃縮乾固させた。その残渣をシリカゲルで精製して、１－｛［３－（２－クロロフェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）オキシラン－２－イル］メチル｝－２－ヨード－１Ｈ－イミダゾールをジアステレオ異性体の５５／４５混合物［２９８ｍｇ、無色の固体、収率７２％；ＨＰＬＣ／ＭＳ：ｍ／ｚ＝４７３（Ｍ＋Ｈ）；ｌｏｇＰ（ＨＣＯＯＨ）＝２．９２（主要なジアステレオ異性体）、３．３１（少量のジアステレオ異性体）］として得た。

【０２１０】
段階５
ｒｅｌ－１－｛［（２Ｒ，３Ｒ）－３－（２－クロロフェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）オキシラン－２－イル］メチル｝－２－ヨード－１Ｈ－イミダゾールとｒｅｌ－１－｛［（２Ｒ，３Ｓ）－３－（２－クロロフェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）オキシラン－２－イル］メチル｝－２－ヨード－１Ｈ－イミダゾールの分離

【０２１１】
【化１４】



上記ジアステレオ異性体混合物のサンプル（２００ｍｇ）を分取ＨＰＬＣ（Ｐｈｅｎｏｍｅｎｅｘ　ＡＸＩＡ　Ｇｅｍｉｎｉ　Ｃ１８；１１０　Ａ；１０μｍ　１００×３０ｍｍ）で分離し、それによって、ｒｅｌ－１－｛［（２Ｒ，３Ｒ）－３－（２－クロロフェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）オキシラン－２－イル］メチル｝－２－ヨード－１Ｈ－イミダゾールが無色の固体［１０３ｍｇ、収率４９％；ＨＰＬＣ／ＭＳ：ｍ／ｚ＝４７３（Ｍ＋Ｈ）；ｌｏｇＰ（ＨＣＯＯＨ）＝２．８６］として得られ、及び、ｒｅｌ－１－｛［（２Ｒ，３Ｓ）－３－（２－クロロフェニル）－２－（２，４－ジフルオロフェニル）オキシラン－２－イル］メチル｝－２－ヨード－１Ｈ－イミダゾールが無色の固体［５３ｍｇ、収率２５％；ＨＰＬＣ／ＭＳ：ｍ／ｚ＝４７３（Ｍ＋Ｈ）；ｌｏｇＰ

（ＨＣＯＯＨ）＝３．２３］として得られた。

【０２１２】

化合物６～１７は、類似した方法で得られた。

【０２１３】

代表的な化合物についての下記表１及び効力についての下記提示又は実施例を参照して、本発明のさまざまな態様について例証する。

【０２１４】

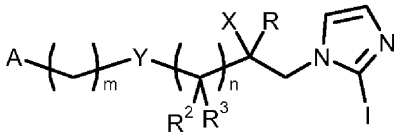
下記表１は、本発明に従う化合物の例について非限定的に例示している。

【０２１５】

表１

【０２１６】

【化１５】



(I)

【０２１７】

【表１】

実施例 No	R	n	X	R2		R3	Y	m	A	立体化学	logP
1	1-クロロシクロプロピル	1	OH	H	/	H	結合	0	2-クロロフェニル		2.35[a]; 3.38[b]
2	1-クロロシクロプロピル	1	OH	H	/	H	結合	0	2-フルオロフェニル		2.05[a]; 3.02[b]
3	1-(4-フルオロフェノキシ)シクロプロピル	0	OH	/	/	/	結合	0	4-クロロフェニル		2.55[a]; 3.55[b]
4	tert-ブチル	1	OH	H	/	H	結合	1	4-クロロフェニル		
5	1-(4-フルオロフェノキシ)シクロプロピル	0	OH	/	/	/	結合	0	2,4-ジフルオロフェニル		
6	4-フルオロフェニル	1	/	/	オキシラン-2-イル	H	結合	0	2-クロロフェニル		2.73 & 3.08 [a]
7	4-フルオロフェニル	1	/	/	オキシラン-2-イル	H	結合	0	2-クロロフェニル	rel (R,R)	2.73[a]
8	4-フルオロフェニル	1	/	/	オキシラン-2-イル	H	結合	0	2-クロロフェニル	rel (R,S)	3.09[a]
9	4-クロロ-2-フルオロフェニル	1	/	/	オキシラン-2-イル	H	結合	0	2-クロロフェニル		3.29 & 3.78 [a]
10	4-クロロ-2-フルオロフェニル	1	/	/	オキシラン-2-イル	H	結合	0	2-クロロフェニル	rel (R,R)	3.23[a]
11	4-クロロ-2-フルオロフェニル	1	/	/	オキシラン-2-イル	H	結合	0	2-クロロフェニル	rel (R,S)	3.7[a]
12	2,4-ジフルオロフェニル	1	/	/	オキシラン-2-イル	H	結合	0	2-クロロフェニル		2.92 & 3.31 [a]
13	2,4-ジフルオロフェニル	1	/	/	オキシラン-2-イル	H	結合	0	2-クロロフェニル	rel (R,R)	2.86[a]
14	2,4-ジフルオロフェニル	1	/	/	オキシラン-2-イル	H	結合	0	2-クロロフェニル	rel (R,S)	3.23[a]
15	2-クロロ-4-フルオロフェニル	1	/	/	オキシラン-2-イル	H	結合	0	2-クロロフェニル		3.13 & 3.57 [a]
16	2-クロロ-4-フルオロフェニル	1	/	/	オキシラン-2-イル	H	結合	0	2-クロロフェニル	rel (R,R)	3.13[a]
17	2-クロロ-4-フルオロフェニル	1	/	/	オキシラン-2-イル	H	結合	0	2-クロロフェニル	rel (R,S)	3.68[a]
18	1-クロロシクロプロピル	1	OH	H	/	H	結合	0	2-クロロ-6-ヨードフェニル		3.04[a]; 4[b]

logP値は、「EEC directive 79／831 Annex V. A8

」に従い、下記方法を用いて、逆相カラムでのＨＰＬＣ（高性能液体クロマトグラフィー）で測定した：

［ａ］ＬＣ－ＭＳによる測定は、水中の０．１％ギ酸及びアセトニトリル（０．１％ギ酸含有）を移動相として使用し、１０％アセトニトリルから９５％アセトニトリルまでの直線勾配を用いて、ｐＨ２．７で実施した；

［ｂ］ＬＣ－ＭＳによる測定は、０．００１モル重炭酸アンモニウム水溶液を移動相として使用し、１０％アセトニトリルから９５％アセトニトリルまでの直線勾配を用いて、ｐＨ７．８で実施した。

【０２１８】

校正は、ｌｏｇＰ値が既知である非分枝鎖アルカン－２－オン（３個～１６個の炭素原子を有している）を用いて実施した（ｌｏｇＰ値は、連続する２種類のアルカノンの間の線形補間を用いて、保持時間によって決定した）。 ラムダマックス値は、２００ｎｍ～４００ｎｍの紫外線スペクトルを使用し、クロマトグラフシグナルの最大値で決定した。

【０２１９】

ＮＭＲデータ

選択された実施例のＮＭＲデータ

選択された実施例に関するＮＭＲデータは、慣習的な形態（δ値、水素原子の数、多重項分裂）で、又は、ＮＭＲピークリストとして、記載される。

【０２２０】

実施例１： ^{1}Ｈ ＮＭＲ：δ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－Ｄ６）＝０．６２－０．９７（ｍ，４Ｈ），３．１１（ｄ，１Ｈ），３．２２（ｄ，１Ｈ），４．０１（ｄ，１Ｈ），４．３３（ｄ，１Ｈ），５．１４（ｓ，１Ｈ；ＯＨ），６．９７（ｓ，１Ｈ）７．２４－７．３２（ｍ，２Ｈ），７．３７（ｓ，１Ｈ），７．４０－７．６３（ｍ，２Ｈ）ｐｐｍ。

【０２２１】

実施例２： ^{1}Ｈ ＮＭＲ：δ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－Ｄ６）＝０．５８－０．８７（ｍ，４Ｈ），２．８２（ｄ，１Ｈ），３．１０（ｄ，１Ｈ），４．１８（ｄ，１Ｈ），４．２６（ｄ，１Ｈ），５．１６（ｓ，１Ｈ；ＯＨ），６．９８（ｓ，１Ｈ）７．０９－７．３１（ｍ，３Ｈ），７．３９（ｓ，１Ｈ），７．４５－７．５０（ｍ，１Ｈ）ｐｐｍ。

【０２２２】

実施例３： ^{1}Ｈ ＮＭＲ：δ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－Ｄ６）＝０．５６－０．７５（ｍ，４Ｈ），４．５０（ｄ，１Ｈ），４．６０（ｄ，１Ｈ），５．９５（ｓ，１Ｈ，ＯＨ），６．６０－６．６４（ｍ，２Ｈ），６．８６（ｓ，１Ｈ），６．９６（ｔ，２Ｈ），７．２６（ｓ，１Ｈ），７．３２（ｄ，２Ｈ），７．４９（ｄ，２Ｈ）ｐｐｍ。

【０２２３】

実施例４： ^{1}Ｈ ＮＭＲ：δ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－Ｄ６）＝０．９９（ｓ，９Ｈ），１．０５－１．１５（ｍ，１Ｈ），１．５５－１．７８（ｍ，２Ｈ），２．３－２．４（ｍ，１Ｈ），３．９４（ｄ，１Ｈ），４．１３（ｄ，１Ｈ），４．５８（ｓ，１Ｈ，ＯＨ），６．９７（ｄ，２Ｈ），７．００（ｓ，１Ｈ），７．２７（ｄ，２Ｈ），７．４５（ｓ，１Ｈ）ｐｐｍ。

【０２２４】

実施例５： ^{1}Ｈ ＮＭＲ：δ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－Ｄ６）＝０．７５－０．８３（ｍ，２Ｈ），０．９７－１．０２（ｍ，１Ｈ），１．１６－１．２２（ｍ，１Ｈ），４．５２（ｄ，２Ｈ），６．１７（ｓ，１Ｈ），６．６３－６．６８（ｍ，２Ｈ），６．８４（ｓ，１Ｈ），６．９１（ｔ，２Ｈ），６．９８－７．０６（ｍ，２Ｈ），７．２２（ｓ，１Ｈ），７．５３－７．６０（ｍ，１Ｈ）ｐｐｍ。

【０２２５】

ＮＭＲピークリスト

選択された実施例に関する１Ｈ ＮＭＲデータが１Ｈ ＮＭＲピークリストの形態で示

されている場合、各シグナルピークに対して、最初にδ値（ｐｐｍ）が記載され、次に、丸括弧内に、シグナル強度が記載されている。種々のシグナルピークに関するδ値－シグナル強度数の対が、セミコロンで互いに区切られて記載されている。

【０２２６】

従って、１つの例に対するピークリストは、以下の形態で示される：

δ_1（強度$_1$）；δ_2（強度$_2$）；．．．；δ_i（強度$_i$）；．．．；δ_n（強度$_n$）。

【０２２７】

ＮＭＲピークリスト表

【０２２８】

【表２】

実施例 **6,** 溶媒**: CDCl3,** 分光計**: 499.93 MHz** 7.5882 (3.58); 7.5840 (3.84); 7.5740 (3.91); 7.5704 (4.40); 7.5046 (3.90); 7.5019 (3.46); 7.4905 (4.96); 7.4868 (5.12); 7.4748 (0.43); 7.4190 (1.66); 7.4071 (4.92); 7.4044 (4.90); 7.3974 (5.43); 7.3934 (7.76); 7.3828 (4.30); 7.3791 (3.64); 7.3679 (1.40); 7.3645 (1.09); 7.3360 (5.98); 7.3322 (3.47); 7.3255 (7.02); 7.3188 (7.44); 7.3119 (4.02); 7.3083 (6.63); 7.2634 (10.28); 7.2528 (7.03); 7.2509 (6.81); 7.2302 (3.46); 7.2144 (4.24); 7.1321 (4.27); 7.1220 (10.46); 7.1150 (5.26); 7.1044 (4.42); 7.0933 (1.83); 7.0903 (1.77); 7.0779 (3.00); 7.0756 (3.04); 7.0627 (1.89); 7.0596 (1.95); 7.0467 (6.61); 7.0294 (13.12); 7.0215 (14.12); 7.0156 (16.00); 7.0132 (13.79); 7.0007 (2.38); 6.9849 (3.90); 6.9702 (2.46); 6.9472 (3.93); 6.9449 (3.85); 6.9319 (2.17); 6.8528 (4.15); 6.8355 (7.60); 6.8182 (3.71); 4.6028 (3.79); 4.5724 (5.56); 4.4513 (5.71); 4.4210 (4.00); 4.4056 (7.25); 4.3757 (7.78); 4.2513 (12.68); 4.2066 (8.28); 3.6910 (7.87); 3.6611 (7.32); 1.7319 (4.59); -0.0002 (9.27)
実施例 **7,** 溶媒**: CDCl3,** 分光計**: 499.93 MHz** 7.2638 (10.31); 7.2541 (12.32); 7.2513 (12.46); 7.2312 (5.13); 7.2293 (5.23); 7.2153 (6.35); 7.2133 (6.30); 7.1385 (1.04); 7.1327 (7.62); 7.1258 (12.54); 7.1228 (16.00); 7.1195 (5.07); 7.1151 (8.68); 7.1089 (3.77); 7.1046 (8.03); 7.0988 (1.24); 7.0937 (2.60); 7.0902 (2.65); 7.0785 (4.38); 7.0750 (4.39); 7.0632 (2.70); 7.0596 (2.83); 7.0011 (2.46); 6.9993 (2.45); 6.9858 (5.45); 6.9840 (5.37); 6.9710 (3.53); 6.9693 (3.42); 6.9482 (5.87); 6.9447 (5.79); 6.9328 (3.21); 6.9293 (2.88); 6.8589 (1.01); 6.8532 (8.17); 6.8489 (2.57); 6.8396 (3.29); 6.8358 (14.56); 6.8318 (3.10); 6.8225 (2.59); 6.8183 (7.10); 6.8126 (0.88); 4.6035 (7.31); 4.5732 (10.65); 4.4520 (11.35); 4.4216 (7.85); 4.2070 (13.91); 1.7293 (0.47); 1.2533 (0.81); 0.0709 (0.43); 0.0063 (0.45); -0.0002 (10.47); -0.0068 (0.36)
実施例 **8,** 溶媒**: CDCl3,** 分光計**: 499.93 MHz** 7.5170 (3.49); 7.5124 (3.84); 7.5029 (3.79); 7.4987 (4.33); 7.4337 (4.07); 7.4307 (3.32); 7.4194 (5.33); 7.4155 (5.51); 7.4035 (0.39); 7.3510 (1.21); 7.3478 (1.71); 7.3361 (4.99); 7.3330 (4.90); 7.3266 (5.22); 7.3225 (7.63); 7.3185 (4.55); 7.3118 (4.37); 7.3078 (3.67); 7.2969 (1.51); 7.2931 (1.10); 7.2829 (0.38); 7.2704 (0.98); 7.2647 (6.55); 7.2605 (3.26); 7.2542 (7.36); 7.2472 (8.07); 7.2409 (3.97); 7.2367 (7.58); 7.2313 (1.67); 7.2175 (0.63); 7.1910 (9.38); 7.1820 (0.59); 7.1587 (0.32); 7.1424 (0.35); 6.9813 (1.12); 6.9757 (7.22); 6.9716 (2.77); 6.9583 (14.38); 6.9541 (11.83); 6.9517 (13.88); 6.9450 (16.00); 6.9420 (13.16); 4.3344 (8.05); 4.3045 (8.71); 4.1798 (13.19); 3.6193 (9.12); 3.5894 (8.48); 3.0215 (0.35); 2.9148 (0.36); 2.4491 (0.33); 1.6635 (0.51); 1.3576 (7.35); 1.1823 (0.86); -0.0002 (15.97); -0.0654 (0.53); -0.0716 (9.55); -0.0779 (0.55)
実施例 **10,** 溶媒**: CDCl3,** 分光計**: 400.13 MHz** 7.2443 (0.37); 7.2350 (0.47); 7.2313 (0.55); 7.2200 (5.93); 7.2175 (6.15); 7.2000 (7.91); 7.1973 (8.36); 7.1936 (15.71); 7.1842 (13.92); 7.1808 (14.43); 7.1696 (0.38); 7.1146 (0.32); 7.0612 (3.43); 7.0571 (3.64); 7.0477 (13.46); 7.0441 (14.93); 7.0383 (5.89); 7.0227 (3.82); 7.0181 (6.26); 6.9975 (7.08); 6.9895 (1.12); 6.9780 (5.03); 6.9136 (3.32); 6.9115 (3.38); 6.8951 (11.19); 6.8919 (11.68); 6.8756 (6.91); 6.8717 (5.38); 6.8393 (0.36); 6.8278 (6.23); 6.8230 (5.41); 6.8036 (6.18); 6.7988 (5.48); 6.7649 (5.79); 6.7610 (5.79); 6.7456 (4.51); 6.7416 (4.29); 4.6524 (7.01); 4.6145 (8.68); 4.3251 (10.78); 4.3106 (16.00); 4.2873 (8.57); 2.8839 (1.20); 2.8113 (1.01); 1.6934 (0.38); 1.1819 (1.01); 0.0088 (0.69); -0.0002 (17.87); -0.0094 (0.73); -0.0632 (0.37); -0.0714 (9.51); -0.0796 (0.39)
実施例 **11,** 溶媒**: CDCl3,** 分光計**: 400.13 MHz** 7.5243 (1.47); 7.5160 (1.36); 7.5075 (1.08); 7.5055 (1.10); 7.5011 (1.79); 7.4331 (1.61); 7.4282 (1.11); 7.4231 (0.97); 7.4164 (1.47); 7.4102 (2.35); 7.4001 (0.33); 7.3515 (0.35); 7.3460 (0.74); 7.3329 (2.59); 7.3282 (3.82); 7.3191 (4.48); 7.3103 (2.98); 7.3053 (1.74); 7.2925 (0.49); 7.1918 (6.31); 7.0978 (1.65); 7.0892 (2.12); 7.0844 (2.39); 7.0776 (3.33); 7.0645 (2.13); 7.0588 (3.81); 7.0069 (2.59); 7.0022 (2.18); 6.9929 (0.52); 6.9859 (1.59); 6.9815 (1.47); 6.9418 (16.00); 4.4194 (2.74); 4.3817 (3.01); 4.2403 (5.88); 3.6851 (3.77); 3.6475 (3.43); 2.8844 (1.06); 2.8116 (0.94); 1.3437 (0.49); 1.1825 (0.60); -0.0002 (5.48); -0.0717 (4.07)
実施例 **12,** 溶媒**: CDCl3,** 分光計**: 300.16 MHz** 7.6388 (2.30); 7.6250 (2.29); 7.6197 (1.46); 7.6159 (1.75); 7.6131 (1.85); 7.6075 (3.28); 7.5483 (2.61); 7.5411 (1.70); 7.5301 (2.08); 7.5263 (2.34); 7.5175 (4.43); 7.5048 (0.66); 7.4702 (0.37); 7.4623 (1.11); 7.4453 (5.03); 7.4407 (5.70); 7.4276 (7.77); 7.4148 (3.86); 7.4102 (3.08); 7,3932 (0,70); 7,3852 (0,42); 7,3327 (5,29); 7,3295 (5,34); 7,3060 (7,74); 7,2985 (17,31); 7,2940 (13,83); 7,2519 (1,70); 7,2306 (1,89); 7,2237 (3,35); 7,2026 (3,35); 7,1960 (2,07); 7,1701 (5,17); 7,1646 (3,98); 7,1572 (12,71); 7,1528 (12.39); 7.1411 (8.66); 7.1199 (6.60); 7.1139 (5.63); 7.0931 (2.48); 7.0714 (0.36); 7.0483 (13.03); 7.0446 (13.59); 7.0401 (5.03); 7.0279 (0.59); 7.0153 (3.09); 7.0125 (3.03); 6.9896 (6.07); 6.9648 (3.25); 6.9479 (0.32); 6.9367 (1.65); 6.9286 (2.00); 6.9075 (1.90); 6.8999 (2.58); 6.8949 (2.35); 6.8659 (3.83); 6.8596 (7.21); 6.8545 (6.04); 6.8412 (3.36); 6.8336 (6.55); 6.8148 (1.68); 6.8067 (1.28); 6.7613 (1.85); 6.7584 (1.92); 6.7531 (2.20); 6.7320 (3.53); 6.7243 (4.03); 6.7058 (1.69); 6.7033 (1.69); 6.6978 (1.98); 6.6705 (2.93); 6.6624 (2.37); 6.6412 (3.37); 6.6368 (3.70); 6.6291 (2.86); 6.6080 (2.83); 6.5999 (2.41); 4.9593 (0.33); 4.7622 (6.70); 4.7118 (9.01); 4.5042 (4.91); 4.4542 (5.71); 4.4321 (11.04); 4.4218 (16.00); 4.3817 (8.05); 4.3630 (10.69); 3.8130 (7.15); 3.7630 (6.23); 2.9940 (0.89); 2.9213 (0.77); 2.0828 (0.65); 1.6740 (5.17); 1.3406 (0.43); 1.3187 (0.80); 1.3002 (2.60); 1.2714 (0.40); 0.9379 (0.91); 0.9161 (2.78); 0.8927 (1.05)
実施例 **13,** 溶媒**: CDCl3,** 分光計**: 400.13 MHz** 7.3152 (0.38); 7.2929 (5.45); 7.2904 (5.69); 7.2728 (7.40); 7.2703 (7.83); 7.2649 (21.10); 7.2604 (14.20); 7.1267 (4.53); 7.1216 (13.75); 7.1181 (12.28); 7.1084 (7.12); 7.1044 (8.62); 7.0846 (5.19); 7.0680 (2.10); 6.9732 (2.94); 6.9712 (2.99); 6.9538 (5.77); 6.9521 (5.82); 6.9353 (3.12); 6.9334 (3.03); 6.8214 (5.42); 6.8175 (5.50); 6.8019 (4.28); 6.7981 (4.16); 6.7180 (1.73); 6.7158 (1.87); 6.7119 (2.00); 6.7099 (1.99); 6.6960 (3.38); 6.6902 (3.67);

6.6764 (1.61); 6.6743 (1.70); 6.6703 (1.86); 6.6685 (1.80); 6.6262 (2.70); 6.6201 (2.34); 6.6042 (3.14); 6.6009 (3.54); 6.5986 (3.22); 6.5951 (2.80); 6.5792 (2.66); 6.5732 (2.28); 4.7203 (6.59); 4.6825 (8.20); 4.3917 (11.40); 4.3870 (16.00); 4.3541 (8.04); 2.0101 (2.45); 1.7293 (6.61); 0.0079 (0.33); -0.0002 (9.31); -0.0085 (0.33)
実施例 **14,** 溶媒**: CDCl3,** 分光計**: 400.13 MHz** 7.6081 (0.35); 7.5980 (3.06); 7.5904 (2.99); 7.5855 (1.92); 7.5825 (2.13); 7.5808 (2.36); 7.5786 (2.37); 7.5747 (3.83); 7.5669 (0.39); 7.5151 (0.33); 7.5061 (3.70); 7.5014 (2.52); 7.3974 (5.43); 7.4973 (1.95); 7.4908 (3.04); 7.4889 (3.44); 7.4831 (5.49); 7.4724 (0.64); 7.4242 (0.69); 7.4190 (1.49); 7.4055 (5.61); 7.4003 (8.88); 7.3911 (11.48); 7.3825 (6.91); 7.3766 (3.61); 7.3638 (0.93); 7.3580 (0.56); 7.2654 (8.06); 7.2063 (2.08); 7.1904 (2.38); 7.1852 (3.97); 7.1694 (4.00); 7.1644 (2.50); 7.1485 (2.22); 7.0583 (0.32); 7.0154 (6.74); 7.0120 (14.54); 7.0081 (16.00); 7.0046 (6.78); 6.9958 (0.51); 6.8911 (2.11); 6.8850 (2.39); 6.8693 (2.43); 6.8651 (2.89); 6.8635 (3.09); 6.8596 (2.72); 6.8439 (2.04); 6.8378 (2.45); 6.8255 (1.93); 6.8232 (1.88); 6.8193 (1.58); 6.8172 (1.53); 6.8036 (3.28); 6.7976 (2.72); 6.7840 (1.65); 6.7817 (1.64); 6.7778 (1.37); 6.7757 (1.29); 4.4606 (6.14); 4.4230 (6.76); 4.3259 (13.09); 3.7708 (9.14); 3.7332 (8.25); 1.8165 (1.68); -0.0002 (4.90)
実施例 **15,** 溶媒**: CDCl3,** 分光計**: 499.93 MHz** 7.6114 (1.12); 7.6065 (1.15); 7.5972 (1.03); 7.5928 (1.27); 7.5109 (1.28); 7.5077 (0.93); 7.5056 (0.77); 7.4969 (1.57); 7.4926 (1.65); 7.4246 (0.44); 7.4211 (0.64); 7.4098 (1.66); 7.4063 (1.56); 7.4015 (1.71); 7.3963 (2.80); 7.3916 (1.30); 7.3867 (1.39); 7.3825 (1.15); 7.3718 (0.46); 7.3676 (0.35); 7.3053 (5.33); 7.2893 (6.44); 7.2693 (8.00); 7.2594 (8.05); 7.2467 (2.94); 7.2313 (2.17); 7.1745 (1.71); 7.1694 (1.63); 7.1579 (1.74); 7.1528 (1.69); 7.1476 (1.45); 7.1355 (2.04); 7.1234 (16.00); 7.1211 (13.34); 7.1106 (5.41); 7.1083 (5.20); 7.0953 (2.87); 7.0923 (2.62); 7.0765 (0.36); 7.0450 (0.38); 7.0323 (3.06); 7.0300 (3.52); 7.0166 (1.16); 6.9553 (0.48); 6.9520 (0.48); 6.9254 (0.40); 6.9032 (3.28); 6.8985 (4.39); 6.8826 (7.46); 6.8703 (6.03); 6.8560 (3.08); 6.8169 (0.35); 6.8144 (0.32); 6.5919 (3.14); 6.5767 (2.81); 4.8481 (3.01); 4.8180 (3.32); 4.5801 (6.05); 4.5391 (0.55); 4.5086 (0.54); 4.4224 (4.41); 4.2811 (3.50); 4.2510 (3.09); 3.9450 (0.54); 3.9151 (0.51); 2.9533 (1.14); 2.8821 (1.01); 1.6010 (7.32); 1.2559 (0.98); 0.1166 (0.35); 0.0698 (0.51); 0.0060 (4.77); -0.0002 (79.00); -0.0067 (2.76); -0.1199 (0.36)
実施例 **16,** 溶媒**: CDCl3,** 分光計**: 400.13 MHz** 7.3366 (0.37); 7.3097 (6.22); 7.2884 (8.29); 7.2768 (10.52); 7.2639 (26.22); 7.2440 (3.78); 7.2388 (3.90); 7.2236 (3.19); 7.2137 (0.72); 7.1775 (0.36); 7.1275 (16.00); 7.1243 (14.73); 7.1147 (6.42); 7.1113 (6.30); 7.0953 (3.52); 7.0915 (3.37); 7.0776 (0.45); 6.9044 (5.02); 6.8844 (9.36); 6.8772 (6.31); 6.8693 (5.86); 6.8562 (4.95); 6.5926 (4.51); 6.5737 (4.03); 4.8555 (5.03); 4.8179 (5.73); 4.5828 (10.23); 4.2828 (6.03); 4.2452 (5.19); 4.1303 (0.55); 4.1124 (0.55); 2.0465 (2.42); 1.6984 (1.66); 1.2774 (0.74); 1.2595 (1.69); 1.2534 (0.96); 1.2417 (0.76); 0.0794 (0.46); 0.0704 (12.64); 0.0612 (0.56); 0.0079 (0.58); -0.0002 (16.22); -0.0084 (0.69)
実施例 **17,** 溶媒**: CDCl3,** 分光計**: 300.16 MHz** 7.6662 (0.41); 7.6532 (3.62); 7.6420 (3.19); 7.6376 (2.36); 7.6336 (2.33); 7.6300 (2.73); 7.6278 (2.82); 7.6221 (4.95); 7.5835 (0.40); 7.5675 (0.51); 7.5564 (4.22); 7.5496 (2.69); 7.5428 (2.38); 7.5340 (3.90); 7.5256 (6.57); 7.5124 (1.28); 7.5034 (0.78); 7.4888 (0.42); 7.4834 (0.60); 7.4779 (0.92); 7.4704 (1.96); 7.4533 (6.80); 7.4471 (10.09); 7.4348 (12.02); 7.4231 (7.17); 7.4164 (4.33); 7.3995 (1.08); 7.3916 (0.64); 7.3381 (0.52); 7.3346 (0.55); 7.3295 (0.64); 7.3187 (0.86); 7.2983 (2.07); 7.2205 (5.39); 7.2121 (5.65); 7.1926 (6.02); 7.1872 (6.49); 7.1848 (6.92); 7.1677 (4.95); 7.1589 (6.34); 7.1390 (5.54); 7.0988 (0.55); 7.0903 (0.72); 7.0694 (15.45); 6.9979 (0.73); 6.9926 (0.68); 6.9536 (3.40); 6.9451 (3.23); 6.9267 (4.55); 6.9183 (4.32); 6.8984 (2.76); 6.8899 (2.55); 4.5836 (2.47); 4.5337 (2.92); 4.4616 (16.00); 3.9893 (3.06); 3.9394 (2.64); 2.0825 (0.78); 2.0456 (0.59); 1.6800 (4.07); 1.3192 (0.57); 1.2887 (2.34); 1.2717 (0.54); 0.9147 (0.34); 0.1175 (1.14); 0.1055 (30.77); 0.0933 (1.53)
実施例 **18,** 溶媒**: DMSO,** 分光計**: 399.95 MHz** 7.9020 (6.61); 7.8998 (6.90); 7.8824 (7.07); 7.8801 (7.00); 7.5163 (7.71); 7.5135 (7.99); 7.4963 (8.69); 7.4936 (8.31); 7.3867 (13.40); 7.3837 (13.57); 7.0283 (7.59); 7.0084 (13.90); 6.9387 (16.00); 6.9355 (15.89); 4.7853 (6.55); 4.5763 (6.21); 4.5399 (7.19); 4.1270 (3.47); 4.0907 (3.02); 3.6333 (0.46); 3.5609 (2.99); 3.3223 (98.65); 2.6754 (0.66); 2.6709 (0.91); 2.6663 (0.65); 2.5412 (0.88); 2.5241 (3.34); 2.5108 (52.94); 2.5064 (104.59); 2.5018 (136.90); 2.4973 (98.76); 2.4928 (47.60); 2.3331 (0.68); 2.3285 (0.92); 2.3241 (0.67); 2.0743 (0.69); 1.1589 (1.48); 1.1402 (2.46); 0.9038 (1.36); 0.8954 (1.87); 0.8858 (3.67); 0.8758 (9.17); 0.8617 (10.44); 0.8509 (3.52); 0.8416 (1.74); 0.8328 (1.37); 0.7271 (1.24); 0.7163 (0.79); 0.7051 (3.30); 0.6965 (3.17); 0.6924 (3.87); 0.6865 (3.08); 0.6736 (2.45); 0.6635 (1.36); 0.0079 (2.67); -0.0002 (69.17); -0.0085 (2.37)

先鋭なシグナルの強度は、ＮＭＲスペクトルの印刷された例におけるシグナルの高さ（ｃｍ）と相関し、シグナル強度の真の比率を示している。幅が広いシグナルの場合、数種類のピーク又は該シグナルの中央及びそれらの相対的強度が、当該スペクトルの中の最も強いシグナルとの比較で示され得る。

【０２２９】

１Ｈ　ＮＭＲスペクトルの化学シフトを較正するために、テトラメチルシラン、及び／又は、特にスペクトルがＤＭＳＯ中で測定された場合には、その溶媒の化学シフトを使用した。従って、ＮＭＲピークリストでは、テトラメチルシランのピークは存在し得るが、必ずしも存在するわけではない。

【０２３０】

１Ｈ　ＮＭＲピークのリストは、従来の１Ｈ　ＮＭＲのプリントアウトと類似しており、従って、通常、ＮＭＲの慣習的な解釈で記載される全てのピークを含んでいる。

【０２３１】

さらに、それらは、従来の１Ｈ　ＮＭＲのプリントアウトのように、溶媒のシグナル、目標化合物の立体異性体（これも、同様に、本発明の主題の一部分を形成する）のシグナル及び／又は不純物のピークのシグナルも示し得る。

【０２３２】

溶媒及び／又は水のデルタ範囲内における化合物シグナルの報告において、１Ｈ　ＮＭＲピークの本発明者らによるリストは、溶媒の通常のピーク、例えば、ＤＭＳＯ－Ｄ６中のＤＭＳＯのピーク及び水のピーク（これらは、通常、平均して高い強度を有している）を示している。

【０２３３】

目標化合物の立体異性体のピーク及び／又は不純物のピークは、通常、平均して、目標化合物（例えば、９０％を超える純度を有する目標化合物）のピークよりも低い強度を有している。

【０２３４】

そのような立体異性体及び／又は不純物は、特定の調製方法に対して特有であってもよい。従って、それらのピークは、「副産物の指紋（ｂｙ－ｐｒｏｄｕｃｔ　ｆｉｎｇｅｒｐｒｉｎｔｓ）」を参照して、本発明者らの調製方法の再現性を確認するのに役立ち得る。

【０２３５】

目標化合物のピークを既知方法（ＭｅｓｔｒｅＣ、ＡＣＤシミュレーション、さらに、経験的に評価された期待値の使用）で計算する専門家は、必要に応じて、場合により付加的な強度フィルターを使用して、目標化合物のピークを分離することができる。この分離は、１Ｈ　ＮＭＲの慣習的な解釈における関連するピークのピッキングに類似するであろう。

【０２３６】

１Ｈ－ＮＭＲピークリストに関するさらなる詳細については、「Ｒｅｓｅａｒｃｈ　Ｄｉｓｃｌｏｓｕｒｅ　Ｄａｔａｂａｓｅ　Ｎｕｍｂｅｒ　５６４０２５」の中に見いだすことができる。

【０２３７】

使用実施例

実施例Ａ：　アルテルナリア（Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ）試験（トマト）／保護

溶媒：　４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド

乳化剤：　１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、１重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃縮物を水で希釈して、所望の濃度とする。保護活性について試験するために、トマト幼植物に、活性化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。その処理の１日後、該植物に、アルテルナリア・ソラニ（Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ　ｓｏｌａｎｉ）の胞子の懸濁液を用いて接種し、次いで、その植物を、２２℃で相対湿度１００％に２４時間維持する。次いで、その植物を、温度２０℃で相対大気湿度９６％に維持する。評価は、上記接種の７日後に行う。０％は、対照の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【０２３８】

この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：

【０２３９】

【表３】

実施例 No.	効力 (%)
1	88
2	95

実施例Ｂ：　スファエロテカ（Ｓｐｈａｅｒｏｔｈｅｃａ）試験（キュウリ）／保護

溶媒：　４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド

乳化剤：　１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、１重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃縮物を水で希釈して、所望の濃度とする。保護活性について試験するために、キュウリ幼植物に、活性化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。その処理の１日後、該植物に、スファエロテカ・フリギネア（Ｓｐｈａｅｒｏｔｈｅｃａ　ｆｕｌｉｇｉｎｅａ）の胞子の懸濁液を用いて接種する。次いで、その植物を、温度２３℃で相対空気湿度７０％の温室の中に置く。評価は、上記接種の７日後に行う。０％は、対照の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【０２４０】

この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：

【０２４１】

【表４】

実施例 No.	効力 (%)
1	80
2	92
5	88

実施例Ｃ：　ピリクラリア（Ｐｙｒｉｃｕｌａｒｉａ）試験（イネ）／保護

溶媒：　４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド

乳化剤：　１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、１重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃縮物を水で希釈して、所望の濃度とする。保護活性について試験するために、イネ幼植物に、活性化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。その処理の１日後、該植物に、ピリクラリア・オリザエ（Ｐｙｒｉｃｕｌａｒｉａ　ｏｒｙｚａｅ）の胞子の水性懸濁液を用いて接種し、次いで、その植物を、２４℃で相対大気湿度１００％に４８時間維持する。次いで、その植物を、温度２４℃で相対大気湿度８０％の温室の中に置く。評価は、上記接種の７日後に行う。０％は、対照の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【０２４２】

この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：

【０２４３】

【表５】

実施例 No.	効力 (%)
1	95
2	80
4	80
5	95

実施例Ｄ：　ベンツリア（Ｖｅｎｔｕｒｉａ）試験（リンゴ）／保護

溶媒：　２４．５重量部のアセトン
２４．５重量部のジメチルアセトアミド
乳化剤：　１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、１重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃縮物を水で希釈して、所望の濃度とする。保護活性について試験するために、幼植物に、活性化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。噴霧による被膜が乾燥した後、該植物に、リンゴ黒星病の病原菌であるベンツリア・イナエクアリス（Ｖｅｎｔｕｒｉａ　ｉｎａｅｑｕａｌｉｓ）の分生子の水性懸濁液を用いて接種し、次いで、その植物を、約２０℃で相対大気湿度１００％のインキュベーション室の中に１日間維持する。次いで、その植物を、約２１℃で相対大気湿度約９０％の温室の中に置く。評価は、上記接種の１０日後に行う。０％は、対照の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【０２４４】

この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度１００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：

【０２４５】

【表６】

実施例 No.	効力 (%)
1	100
8	100
14	100

実施例Ｅ：　ウロミセス（Ｕｒｏｍｙｃｅｓ）試験（インゲンマメ）／保護

溶媒：　２４．５重量部のアセトン
２４．５重量部のＮ，Ｎ－ジメチルアセトアミド
乳化剤：　１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、１重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃縮物を水で希釈して、所望の濃度とする。保護活性について試験するために、幼植物に、活性化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。噴霧による被膜が乾燥した後、該植物に、インゲンマメさび病の病原菌であるウロミセス・アペンジクラツス（Ｕｒｏｍｙｃｅｓ　ａｐｐｅｎｄｉｃｕｌａｔｕｓ）の胞子の水性懸濁液を用いて接種し、次いで、その植物を、約２０℃で相対大気湿度１００％のインキュベーション室の中に１日間維持する。次いで、その植物を、約２１℃で相対大気湿度約９０％の温室の中に置く。

【０２４６】

評価は、上記接種の１０日後に行う。０％は、対照の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【０２４７】

この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度１０ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：

【０２４８】

【表７】

実施例 No.	効力 (%)
1	100
1	88
2	91
2	100
8	100
17	75

実施例Ｆ：　ファコプソラ（Ｐｈａｋｏｐｓｏｒａ）試験（ダイズ）／保護

溶媒：　２４．５重量部のアセトン

２４．５重量部のＮ，Ｎ－ジメチルアセトアミド

乳化剤：　１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、１重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃縮物を水で希釈して、所望の濃度とする。保護活性について試験するために、幼植物に、活性化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。噴霧による被膜が乾燥した後、該植物に、ダイズさび病の病原菌であるファコプソラ・パキリジ（Ｐｈａｋｏｐｓｏｒａ　ｐａｃｈｙｒｈｉｚｉ）の胞子の水性懸濁液を用いて接種し、次いで、その植物を、約２４℃で相対大気湿度約９５％のインキュベーション室の中に暗闇で２４時間維持する。約２４℃、相対大気湿度約８０％で、１２時間光／１２時間暗闇の昼／夜の周期を用いて、さらにインキュベーションを実施する。評価は、上記接種の７日後に行う。０％は、対照の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【０２４９】

この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度１００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：

【０２５０】

【表８】

実施例 No.	効力 (%)
1	98
8	99
14	100

実施例Ｇ：　ブルメリア・グラミニス（Ｂｌｕｍｅｒｉａ　ｇｒａｍｉｎｉｓ）試験（オオムギ）／保護

溶媒：　４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルアセトアミド

乳化剤：　１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、１重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃縮物を水で希釈して、所望の濃度とする。保護活性について試験するために、幼植物に、活性化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。その噴霧による被膜が乾燥した後、該植物に、ブルメリア・グラミニス　ｆ．ｓｐ．ホルデイ（Ｂｌｕｍｅｒｉａ　ｇｒａｍｉｎｉｓ　ｆ．ｓｐ．　ｈｏｒｄｅｉ）の胞子を振

りかける。その植物を、温度約１８℃で相対大気湿度約８０％の温室の中に置いて、うどんこ病によるいぼ状隆起（ｍｉｌｄｅｗ　ｐｕｓｔｕｌｅ）の発生を促進する。評価は、上記接種の７日後に行う。０％は、対照の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【０２５１】

この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：

【０２５２】

【表９】

実施例 No.	効力 (%)
1	100
2	100
14	90

実施例Ｈ：　レプトスファエリア・ノドルム（Ｌｅｐｔｏｓｐｈａｅｒｉａ　ｎｏｄｏｒｕｍ）試験（コムギ）／保護

溶媒：　４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルアセトアミド

乳化剤：　１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、１重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃縮物を水で希釈して、所望の濃度とする。保護活性について試験するために、幼植物に、活性化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。その噴霧による被膜が乾燥した後、該植物に、レプトスファエリア・ノドルム（Ｌｅｐｔｏｓｐｈａｅｒｉａ　ｎｏｄｏｒｕｍ）の胞子の懸濁液を噴霧する。その植物を、２０℃で相対大気湿度１００％のインキュベーション室の中に４８時間維持する。その植物を、温度約２２℃で相対大気湿度約８０％で温室の中に置く。評価は、上記接種の８日後に行う。０％は、対照の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【０２５３】

この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：

【０２５４】

【表１０】

実施例 No.	効力 (%)
1	100
2	93

実施例Ｉ：　セプトリア・トリチシ（Ｓｅｐｔｏｒｉａ　ｔｒｉｔｉｃｉ）試験（コムギ）／保護

溶媒：　４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルアセトアミド

乳化剤：　１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、１重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃縮物を水で希釈して、所望の濃度とする。保護活性について試験するために、幼植物に、活性化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。その噴霧による被膜が乾燥した後、該植物に、セプトリア・トリチシ（Ｓｅｐｔｏｒｉａ　ｔｒｉｔｉｃｉ）の胞子の懸濁液を噴霧する。その植物を、２０℃で相対大気湿度１００％のインキュベーション室の中に４８時間維持する。次いで、その植物を、１５℃で相対大気湿度１００％の半透明なフードの下にさらに６０時間置く。その植物を、温度約

１５℃で相対大気湿度約８０％の温室の中に置く。評価は、上記接種の２１日後に行う。０％は、対照の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【０２５５】

この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：

【０２５６】

【表１１】

実施例 No.	効力 (%)
1	100
2	86
12	71
14	100

実施例Ｋ：　ピレノホラ・テレス（Ｐｙｒｅｎｏｐｈｏｒａ　ｔｅｒｅｓ）試験（オオムギ）／保護

溶媒：　４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルアセトアミド

乳化剤：　１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、１重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃縮物を水で希釈して、所望の濃度とする。保護活性について試験するために、幼植物に、活性化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。その噴霧による被膜が乾燥した後、該植物に、ピレノホラ・テレス（Ｐｙｒｅｎｏｐｈｏｒａ　ｔｅｒｅｓ）の胞子の懸濁液を噴霧する。その植物を、２０℃で相対大気湿度１００％のインキュベーション室の中に４８時間維持する。その植物を、温度約２０℃で相対大気湿度約８０％の温室の中に置く。評価は、上記接種の８日後に行う。０％は、対照の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【０２５７】

この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：

【０２５８】

【表１２】

実施例 No.	効力 (%)
1	100
2	100

実施例Ｌ：　プッシニア・トリチシナ（Ｐｕｃｃｉｎｉａ　ｔｒｉｔｉｃｉｎａ）試験（コムギ）／保護

溶媒：　４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルアセトアミド

乳化剤：　１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、１重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃縮物を水で希釈して、所望の濃度とする。保護活性について試験するために、幼植物に、活性化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。その噴霧による被膜が乾燥した後、該植物に、プッシニア・トリチシナ（Ｐｕｃｃｉｎｉａ　ｔｒｉｔｉｃｉｎａ）の胞子の懸濁液を用いて胞子を噴霧する。その植物を、２０℃で相対大気湿度約１００％のインキュベーション室の中に４８時間間維持する。その植

物を、温度約２０℃で相対大気湿度約８０％の温室の中に置く。

【０２５９】

評価は、上記接種の８日後に行う。０％は、対照の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【０２６０】

この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：

【０２６１】

【表１３】

実施例 No.	効力 (%)
1	100
2	100
14	100

実施例Ｍ：　フサリウム・ニバレ（ｖａｒ．マジュス）（Ｆｕｓａｒｉｕｍ　ｎｉｖａｌｅ（ｖａｒ．ｍａｊｕｓ））試験（コムギ）／保護

溶媒：　４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルアセトアミド

乳化剤：　１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、１重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃縮物を水で希釈して、所望の濃度とする。保護活性について試験するために、幼植物に、活性化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。その噴霧による被膜が乾燥した後、該植物に、フサリウム・ニバレ（ｖａｒ．マジュス）（Ｆｕｓａｒｉｕｍ　ｎｉｖａｌｅ（ｖａｒ．ｍａｊｕｓ））の胞子の懸濁液を噴霧する。その植物を、温室内の、１０℃で相対大気湿度１００％の半透明のインキュベーションフードの下に置く。評価は、上記接種の５日後に行う。０％は、対照の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【０２６２】

この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：

【０２６３】

【表１４】

実施例 No.	効力 (%)
1	100
2	100

実施例Ｎ：　ブルメリア・グラミニス（Ｂｌｕｍｅｒｉａ　ｇｒａｍｉｎｉｓ）試験（オオムギ）／保護

溶媒：　４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルアセトアミド

乳化剤：　１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、１重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃縮物を水で希釈して、所望の濃度とする。保護活性について試験するために、幼植物に、活性化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。その噴霧による被膜が乾燥した後、該植物に、フサリウム・グラミネアルム（Ｆｕｓａｒｉｕｍ　ｇｒａｍｉｎｅａｒｕｍ）の胞子の懸濁液を用いて胞子を噴霧する。その植物を、温室内の、２２℃で相対大気湿度１００％の半透明のインキュベーションフードの下に置く。評価は、上記接種の５日後に行う。０％は、対照の効力に相当する効力を意味し

、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。
【０２６４】
この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：
【０２６５】
【表１５】

実施例 No.	効力 (%)
1	100
2	92
2	100

実施例Ｏ：　アルテルナリア・ブラシカエ（Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ　ｂｒａｓｓｉｃａｅ）（ハツカダイコンの黒斑病（ｌｅａｆ　ｓｐｏｔ））を用いたインビボ予防試験
被験活性化合物を、アセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯの混合物の中で均質化することにより調製し、次いで、水で希釈して、所望の活性化合物濃度とする。
【０２６６】
５０／５０の泥炭土／ポゾラン土の底土に播種し、１７℃で成育させたハツカダイコン植物（品種「Ｐｅｒｎｏｄ　Ｃｌａｉｒ」）を、２葉期で、上記のように調製した活性化合物を噴霧することにより処理する。対照として、植物を該活性化合物を含んでいないアセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯ／水の混合物で処理する。
【０２６７】
２４時間経過した後、アルテルナリア・ブラシカエ（Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ　ｂｒａｓｓｉｃａｅ）の胞子の水性懸濁液を葉に噴霧することにより、該植物に接種する。その接種されたハツカダイコン植物を、２０℃、相対大気湿度１００％でインキュベートする。
【０２６８】
評価（効力％）は、接種の５日後に、対照植物と比較して行う。０％は、対照植物の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。
【０２６９】
この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：
【０２７０】
【表１６】

実施例 No.	効力 (%)
6	75
8	88

実施例Ｐ：　ボトリチス・シネレア（Ｂｏｔｒｙｔｉｓ　ｃｉｎｅｒｅａ）（灰色かび病）を用いたインビボ予防試験
被験活性化合物を、アセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯの混合物の中で均質化することにより調製し、次いで、水で希釈して、所望の活性化合物濃度とする。
【０２７１】
５０／５０の泥炭土／ポゾラン土の底土に播種し、２４℃で成育させたキュウリ植物（品種「Ｖｅｒｔ　ｐｅｔｉｔ　ｄｅ　Ｐａｒｉｓ」）を、Ｚ１１子葉期で、上記のように調製した活性化合物を噴霧することにより処理する。対照として、植物を該活性化合物を含んでいないアセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯ／水の混合物で処理する。
【０２７２】

２４時間経過した後、ボトリチス・シネレア（Ｂｏｔｒｙｔｉｓ　ｃｉｎｅｒｅａ）の低温保存された胞子の水性懸濁液を子葉に噴霧することにより、該植物に接種する。その接種されたキュウリ植物を、１７℃、相対大気湿度８０％でインキュベートする。

【０２７３】

評価（効力％）は、接種の４～５日後に、対照植物と比較して行う。０％は、対照植物の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【０２７４】

この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：

【０２７５】

【表１７】

実施例 No.	効力 (%)
11	92
14	97

実施例Ｑ：　フィトフトラ・インフェスタンス（Ｐｈｙｔｏｐｈｔｈｏｒａ　ｉｎｆｅｓｔａｎｓ）（トマトの疫病）を用いたインビボ予防試験

被験活性化合物を、アセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯの混合物の中で均質化することにより調製し、次いで、水で希釈して、所望の活性化合物濃度とする。

【０２７６】

５０／５０の泥炭土／ポゾラン土の底土に播種し、２０～２５℃で成育させたトマト植物（品種「Ｒｅｎｔｉｔａ」）を、Ｚ１２葉期で、上記のように調製した活性化合物を噴霧することにより処理する。対照として、植物を該活性化合物を含んでいないアセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯ／水の混合物で処理する。

【０２７７】

２４時間経過した後、フィトフトラ・インフェスタンス（Ｐｈｙｔｏｐｈｔｈｏｒａ　ｉｎｆｅｓｔａｎｓ）の胞子の水性懸濁液を葉に噴霧することにより、該植物に接種する。その接種されたトマト植物を、湿潤雰囲気下、１６～１８℃でインキュベートする。

【０２７８】

評価（効力％）は、接種の５日後に、対照植物と比較して行う。０％は、対照植物の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【０２７９】

この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：

【０２８０】

【表１８】

実施例 No.	効力 (%)
1	100
12	88
13	98

実施例Ｒ：　ピレノホラ・テレス（Ｐｙｒｅｎｏｐｈｏｒａ　ｔｅｒｅｓ）（オオムギの網斑病）を用いたインビボ予防試験

被験活性化合物を、アセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯの混合物の中で均質化することにより調製し、次いで、水で希釈して、所望の活性化合物濃度とする。

【０２８１】
５０／５０の泥炭土／ポゾラン土の底土に播種し、２２℃（１２時間）／２０℃（１２時間）で成育させたオオムギ植物（品種「Ｐｌａｉｓａｎｔ」）を、１葉期（草丈１０ｃｍ）で、上記のように調製した活性化合物を噴霧することにより処理する。対照として、植物を該活性化合物を含んでいないアセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯ／水の混合物で処理する。
【０２８２】
２４時間経過した後、ピレノホラ・テレス（Ｐｙｒｅｎｏｐｈｏｒａ　ｔｅｒｅｓ）の胞子の水性懸濁液を葉に噴霧することにより、該植物に接種する。その接種されたオオムギ植物を、２０℃、相対大気湿度１００％で４８時間インキュベートし、次いで、相対大気湿度８０％で１２日間インキュベートする。
【０２８３】
評価（効力％）は、接種の１２日後に、対照植物と比較して行う。０％は、対照植物の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。
【０２８４】
この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：
【０２８５】
【表１９】

実施例 No.	効力 (%)
1	100
8	79

実施例Ｓ：　ピリクラリア・オリザエ（Ｐｙｒｉｃｕｌａｒｉａ　ｏｒｙｚａｅ）（イネいもち病）を用いたインビボ予防試験
被験活性化合物を、アセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯの混合物の中で均質化することにより調製し、次いで、水で希釈して、所望の活性化合物濃度とする。
【０２８６】
５０／５０の泥炭土／ポゾラン土の底土に播種し、２５℃で成育させたイネ植物（品種「Ｋｏｓｈｉｈｉｋａｒｉ」）を、２葉期（草丈１０ｃｍ）で、上記のように調製した活性化合物を噴霧することにより処理する。対照として、植物を該活性化合物を含んでいないアセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯ／水の混合物で処理する。
【０２８７】
２４時間経過した後、ピリクラリア・オリザエ（Ｐｙｒｉｃｕｌａｒｉａ　ｏｒｙｚａｅ）の胞子の水性懸濁液を葉に噴霧することにより、該植物に接種する。その接種されたイネ植物を、２５℃、相対大気湿度８０％でインキュベートする。
【０２８８】
評価（効力％）は、接種の６日後に、対照植物と比較して行う。０％は、対照植物の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。
【０２８９】
この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：
【０２９０】

【表２０】

実施例 No.	効力 (%)
1	100
8	75

実施例Ｔ：　プッシニア・レコンジタ（Ｐｕｃｃｉｎｉａ　ｒｅｃｏｎｄｉｔａ）（コムギの赤さび病）を用いたインビボ予防試験

被験活性化合物を、アセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯの混合物の中で均質化することにより調製し、次いで、水で希釈して、所望の活性化合物濃度とする。

【０２９１】

５０／５０の泥炭土／ポゾラン土の底土に播種し、２２℃（１２時間）／２０℃（１２時間）で成育させたコムギ植物（品種「Ｓｃｉｐｉｏｎ」）を、１葉期（草丈１０ｃｍ）で、上記のように調製した活性化合物を噴霧することにより処理する。対照として、植物を該活性化合物を含んでいないアセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯ／水の混合物で処理する。

【０２９２】

２４時間経過した後、プッシニア・レコンジタ（Ｐｕｃｃｉｎｉａ　ｒｅｃｏｎｄｉｔａ）の胞子の水性懸濁液を葉に噴霧することにより、該植物に接種する。その接種されたコムギ植物を、２０℃、相対大気湿度１００％で２４時間インキュベートし、次いで、２０℃、相対大気湿度７０％で１０日間インキュベートする。

【０２９３】

評価（効力％）は、接種の１０日後に、対照植物と比較して行う。０％は、対照植物の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【０２９４】

この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：

【０２９５】

【表２１】

実施例 No.	効力 (%)
1	100
8	97
9	86
11	93
12	93
14	93
15	100
17	100

実施例Ｕ：　セプトリア・トリチシ（Ｓｅｐｔｏｒｉａ　ｔｒｉｔｉｃｉ）（コムギの葉枯病）を用いたインビボ予防試験

被験活性化合物を、アセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯの混合物の中で均質化することにより調製し、次いで、水で希釈して、所望の活性化合物濃度とする。

【０２９６】

５０／５０の泥炭土／ポゾラン土の底土に播種し、２２℃（１２時間）／２０℃（１２

時間）で成育させたコムギ植物（品種「Ｓｃｉｐｉｏｎ」）を、１葉期（草丈１０ｃｍ）で、上記のように調製した活性化合物を噴霧することにより処理する。対照として、植物を該活性化合物を含んでいないアセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯ／水の混合物で処理する。

【０２９７】

２４時間経過した後、セプトリア・トリチシ（Ｓｅｐｔｏｒｉａ　ｔｒｉｔｉｃｉ）の低温保存された胞子の水性懸濁液を葉に噴霧することにより、該植物に接種する。その接種されたコムギ植物を、１８℃、相対大気湿度１００％で７２時間インキュベートし、次いで、相対大気湿度９０％で２１～２８日間インキュベートする。

【０２９８】

評価（効力％）は、接種の２１～２８日後に、対照植物と比較して行う。０％は、対照植物の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【０２９９】

この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：

【０３００】

【表２２】

実施例 No.	効力 (%)
1	100
8	100
9	100
10	96
11	100
12	100
14	100
15	86
17	97

実施例Ｖ：　スファエロテカ・フリギネア（Ｓｐｈａｅｒｏｔｈｅｃａ　ｆｕｌｉｇｉｎｅａ）（キュウリのうどんこ病）を用いたインビボ予防試験

被験活性化合物を、アセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯの混合物の中で均質化することにより調製し、次いで、水で希釈して、所望の活性化合物濃度とする。

【０３０１】

５０／５０の泥炭土／ポゾランの底土に播種し、２４℃で成育させたキュウリ植物（品種「Ｖｅｒｔ　ｐｅｔｉｔ　ｄｅ　Ｐａｒｉｓ」）を、Ｚ１１子葉期で、上記のように調製した活性化合物を噴霧することにより処理する。対照として、植物を該活性化合物を含んでいないアセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯ／水の混合物で処理する。

【０３０２】

２４時間経過した後、スファエロテカ・フリギネア（Ｓｐｈａｅｒｏｔｈｅｃａ　ｆｕｌｉｇｉｎｅａ）の胞子の水性懸濁液を葉に噴霧することにより、該植物に接種する。その接種されたキュウリ植物を、約２０℃／２５℃、相対大気湿度６０／７０％でインキュベートする。

【０３０３】

評価（効力％）は、接種の１２日後に、対照植物と比較して行う。０％は、対照植物の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【０３０４】
この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：
【０３０５】
【表２３】

実施例 No.	効力 (%)
1	100
8	100
9	100
10	98
11	100
12	100
14	100
15	98
17	100
18	100

実施例Ｗ：　ウロミセス・アペンジクラツス（Ｕｒｏｍｙｃｅｓ　ａｐｐｅｎｄｉｃｕｌａｔｕｓ）（インゲンマメのさび病）を用いたインビボ予防試験
被験活性化合物を、アセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯの混合物の中で均質化することにより調製し、次いで、水で希釈して、所望の活性化合物濃度とする。
【０３０６】
５０／５０の泥炭土／ポゾラン土の底土に播種し、２４℃で成育させたインゲンマメ植物（品種「Ｓａｘａ」）を、２葉期（草丈９ｃｍ）で、上記のように調製した活性化合物を噴霧することにより処理する。対照として、植物を該活性化合物を含んでいないアセトン／Ｔｗｅｅｎ／ＤＭＳＯ／水の混合物で処理する。
【０３０７】
２４時間経過した後、ウロミセス・アペンジクラツス（Ｕｒｏｍｙｃｅｓ　ａｐｐｅｎｄｉｃｕｌａｔｕｓ）の胞子の水性懸濁液を葉に噴霧することにより、該植物に接種する。その接種されたインゲンマメ植物を、２０℃、相対大気湿度１００％で２４時間インキュベートし、次いで、２０℃、相対大気湿度７０％で１０日間インキュベートする。
【０３０８】
評価（効力％）は、接種の１０日後に、対照植物と比較して行う。０％は、対照植物の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。
【０３０９】
この試験において、本発明に従う下記化合物は、活性化合物の濃度５００ｐｐｍで、７０％以上の効力を示す：
【０３１０】

【表２４】

実施例 No.	効力 (%)
1	100
8	100
9	93
11	97
12	99
14	100
15	100
17	100
18	100

実施例Ｘ：　プッシニア（Ｐｕｃｃｉｎｉａ）試験（コムギ）／保護

溶媒：　　４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド

乳化剤：　　１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、１重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃縮物を水で希釈して、所望の濃度とする。

【０３１１】

保護活性について試験するために、幼植物に、活性化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。その処理の１日後、該植物に、プッシニア・レコンジタ（Ｐｕｃｃｉｎｉａ　ｒｅｃｏｎｄｉｔａ）の胞子の水性懸濁液を用いて接種する。その植物を、２２℃で相対大気湿度１００％のインキュベーション室の中に４８時間維持する。次いで、その植物を、温度約２０℃で相対空気湿度約８０％の温室の中に置く。

【０３１２】

該試験の評価は、上記接種の７～９日後に行う。０％は、処理されていない対照の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

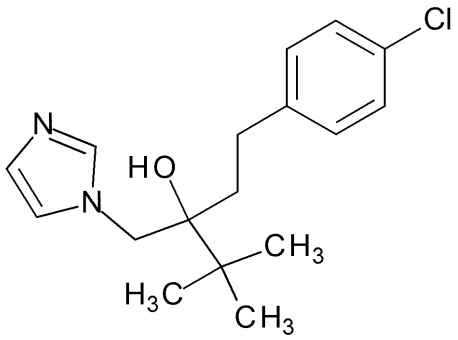
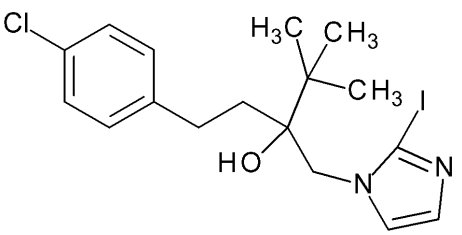
【０３１３】

表：

プッシニア（Ｐｕｃｃｉｎｉａ）試験（コムギ）／保護

【０３１４】

【表２５】

	EP 0087148 から既知である活性化合物：	活性化合物の施用量 (ppm)	効力 (%)
		500	70
	本発明に従う活性化合物：		
実施例 4		500	95

実施例Ｙ：　ウロミセス（Ｕｒｏｍｙｃｅｓ）試験（インゲンマメ）／保護

溶媒：　２４．５重量部のアセトン

２４．５重量部のジメチルアセトアミド

乳化剤：　１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、１重量部の活性化合物を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃縮物を水で希釈して、所望の濃度とする。

【０３１５】

保護活性について試験するために、幼植物に、活性化合物の該調製物を記載されている施用量で噴霧する。その噴霧による被膜が乾燥した後、該植物に、インゲンマメさび病の病原菌であるウロミセス・アペンジクラツス（Ｕｒｏｍｙｃｅｓ　ａｐｐｅｎｄｉｃｕｌａｔｕｓ）の胞子の水性懸濁液を用いて接種し、次いで、その植物を、約２０℃で相対大気湿度１００％のインキュベーション室の中に１日間維持する。

【０３１６】

次いで、その植物を、約２１℃で相対空気湿度約９０％の温室の中に置く。

【０３１７】

該試験の評価は、上記接種の１０日後に行う。０％は、処理されていない対照の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

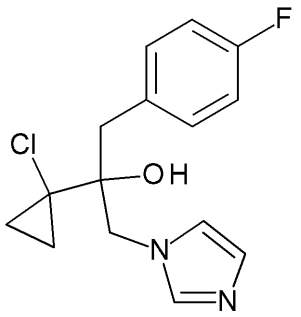
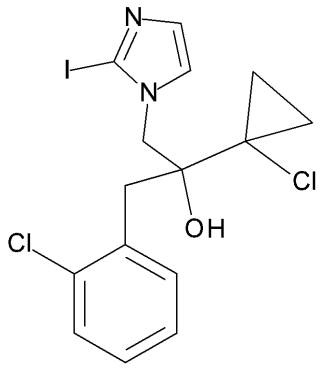
【０３１８】

表：

ウロミセス（Ｕｒｏｍｙｃｅｓ）試験（インゲンマメ）／保護

【０３１９】

【表２６】

	EP 0297345 から既知である活性化合物：	活性化合物 の施用量 (ppm)	効力 (%)
		10	65
	本発明に従う活性化合物：		
実施例 1		10	100

実施例Ｚ：　セプトリア・トリチシ（Ｓｅｐｔｏｒｉａ　ｔｒｉｔｉｃｉ）試験（コムギ）／保護

溶媒：　４９重量部のＮ，Ｎ－ジメチルアセトアミド

乳化剤：　１重量部のアルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を調製するために、１重量部の活性化合物又は活性化合物組合せを上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃縮物を水で希釈して、所望の濃度とする。

【０３２０】

保護活性について試験するために、幼植物に、活性化合物又は活性化合物組合せの該調製物を記載されている施用量で噴霧する。

【０３２１】

その噴霧による被膜が乾燥した後、該植物に、セプトリア・トリチシ（Ｓｅｐｔｏｒｉａ　ｔｒｉｔｉｃｉ）の胞子の懸濁液を噴霧する。その植物を、約２０℃で相対大気湿度約１００％のインキュベーション室の中に４８時間維持し、次いで、約１５℃で、相対大気湿度約１００％の半透明なインキュベーション室の中に６０時間維持する。

【０３２２】

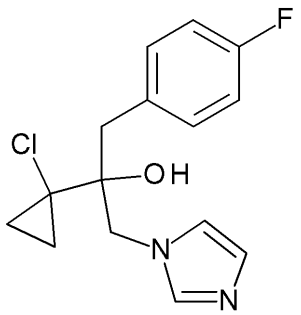
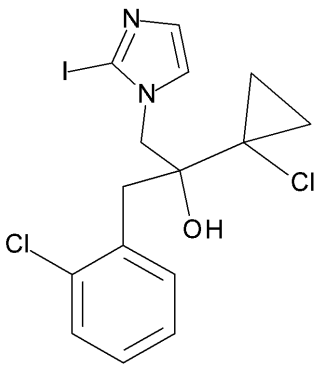
次いで、その植物を、温度約１５℃で相対大気湿度約８０％の温室の中に置く。

【０３２３】

該試験の評価は、上記接種の２１日後に行う。０％は、処理されていない対照の効力に相当する効力を意味し、１００％の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【０３２４】

表：
セプトリア・トリチシ（Ｓｅｐｔｏｒｉａ　ｔｒｉｔｉｃｉ）試験（コムギ）／保護
【０３２５】
【表２７】

	EP 0297345 から既知である活性化合物：	活性化合物 の施用量 (ppm)	効 力 (%)
		250	43
	本発明に従う活性化合物：		
実施例 1:		250	86

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2012/073427

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. A01N43/50 C07D233/68 A01P3/00
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

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 297 345 A1 (BAYER AG) 4 January 1989 (1989-01-04) the whole document	1-9
X	EP 0 087 148 A1 (BAYER AG) 31 August 1983 (1983-08-31) (I), Tabelle 1, Tabelle 2	1-9
X	EP 0 319 481 A1 (SANDOZ AG) 7 June 1989 (1989-06-07) (I), Tabelle A, Seite 8	1-9
X	US 4 118 461 A (ROHM AND HAAS COMPANY) 3 October 1978 (1978-10-03) claim 1; examples 100-102; table III	1-9

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
13 March 2013	28/03/2013

Name and mailing address of the ISA/	Authorized officer
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Breimaier, Waltraud

1

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2012/073427

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0297345 A1	04-01-1989	AR 246066 A1	30-03-1994
		AT 67758 T	15-10-1991
		AU 603677 B2	22-11-1990
		BR 8803076 A	10-01-1989
		CA 1337989 C	23-01-1996
		DE 3812967 A1	05-01-1989
		DK 345488 A	08-02-1989
		EP 0297345 A1	04-01-1989
		ES 2039269 T3	16-09-1993
		GR 3002864 T3	25-01-1993
		HU 204975 B	30-03-1992
		IE 60840 B1	24-08-1994
		IL 86818 A	21-02-1993
		JP 1022857 A	25-01-1989
		JP 6072139 B	14-09-1994
		NZ 225110 A	26-04-1990
		PT 87746 A	01-07-1988
		TR 26815 A	09-08-1994
		US 4913727 A	03-04-1990
		US 4980488 A	25-12-1990
		US 4988819 A	29-01-1991
		US 4990677 A	05-02-1991
		US 5034052 A	23-07-1991
		US 5097047 A	17-03-1992
EP 0087148 A1	31-08-1983	AR 227310 A1	15-10-1982
		AR 229527 A1	15-09-1983
		AT 25522 T	15-03-1987
		AU 542623 B2	28-02-1985
		AU 556515 B2	06-11-1986
		AU 560022 B2	26-03-1987
		AU 3629284 A	04-04-1985
		AU 3629384 A	04-04-1985
		AU 6945681 A	19-11-1981
		BR 8103049 A	09-02-1982
		CA 1341164 C	02-01-2001
		CA 1341521 C	06-03-2007
		DD 158847 A5	09-02-1983
		DD 205602 A5	04-01-1984
		DE 3164696 D1	16-08-1984
		DK 54185 A	06-02-1985
		DK 213081 A	17-11-1981
		EG 14836 A	30-06-1985
		EP 0040345 A1	25-11-1981
		EP 0072580 A2	23-02-1983
		EP 0087148 A1	31-08-1983
		ES 8203859 A1	16-07-1982
		FI 811472 A	17-11-1981
		GR 78229 A1	26-09-1984
		HU 188092 B	28-03-1986
		HU 191148 B	28-01-1987
		HU 191671 B	30-03-1987
		IE 52450 B1	11-11-1987
		IL 62863 A	31-08-1987
		JP 2167270 A	27-06-1990
		JP 2167273 A	27-06-1990
		JP 3072217 B	18-11-1991
		JP 4013349 B	09-03-1992

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2012/073427

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
		NL 971022 I1	01-10-1997
		NZ 197083 A	11-06-1986
		NZ 209126 A	11-06-1986
		OA 6809 A	31-12-1982
		PH 17636 A	18-10-1984
		PH 25782 A	05-11-1991
		PH 25843 A	02-12-1991
		PT 72979 A	01-06-1981
		TR 22042 A	05-02-1986
		TR 22396 A	23-03-1987
		TR 22400 A	31-03-1987
		TR 22691 A	31-03-1988
		US 4532341 A	30-07-1985
		US 4626595 A	02-12-1986
		US 4723984 A	09-02-1988
		US 4789672 A	06-12-1988
		US 4871390 A	03-10-1989
		US 4897107 A	30-01-1990
		US 4904298 A	27-02-1990
		US 4911746 A	27-03-1990
EP 0319481 A1	07-06-1989	AU 2639388 A	22-06-1989
		BR 8806379 A	22-08-1989
		CN 1033381 A	14-06-1989
		CS 8807909 A3	18-03-1992
		DE 3878186 D1	18-03-1993
		DE 3878186 T2	01-07-1993
		DK 669388 A	03-06-1989
		EP 0319481 A1	07-06-1989
		ES 2053808 T3	01-08-1994
		HU 203731 B	30-09-1991
		JP 1199952 A	11-08-1989
		NZ 227144 A	25-09-1991
		PT 89130 A	29-12-1989
		RU 2015971 C1	15-07-1994
		SU 1779248 A3	30-11-1992
		ZA 8809070 A	29-08-1990
US 4118461 A	03-10-1978	NONE	

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2012/073427

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
INV. A01N43/50 C07D233/68 A01P3/00
ADD.

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
A01N C07D

Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)
EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	EP 0 297 345 A1 (BAYER AG) 4. Januar 1989 (1989-01-04) das ganze Dokument -----	1-9
X	EP 0 087 148 A1 (BAYER AG) 31. August 1983 (1983-08-31) (I), Tabelle 1, Tabelle 2 -----	1-9
X	EP 0 319 481 A1 (SANDOZ AG) 7. Juni 1989 (1989-06-07) (I), Tabelle A, Seite 8 -----	1-9
X	US 4 118 461 A (ROHM AND HAAS COMPANY) 3. Oktober 1978 (1978-10-03) Anspruch 1; Beispiele 100-102; Tabelle III -----	1-9

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen ☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
"E" frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist
"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
13. März 2013	28/03/2013

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde	Bevollmächtigter Bediensteter
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Breimaier, Waltraud

1

Formblatt PCT/ISA/210 (Blatt 2) (April 2005)

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2012/073427

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0297345 A1	04-01-1989	AR 246066 A1	30-03-1994
		AT 67758 T	15-10-1991
		AU 603677 B2	22-11-1990
		BR 8803076 A	10-01-1989
		CA 1337989 C	23-01-1996
		DE 3812967 A1	05-01-1989
		DK 345488 A	08-02-1989
		EP 0297345 A1	04-01-1989
		ES 2039269 T3	16-09-1993
		GR 3002864 T3	25-01-1993
		HU 204975 B	30-03-1992
		IE 60840 B1	24-08-1994
		IL 86818 A	21-02-1993
		JP 1022857 A	25-01-1989
		JP 6072139 B	14-09-1994
		NZ 225110 A	26-04-1990
		PT 87746 A	01-07-1988
		TR 26815 A	09-08-1994
		US 4913727 A	03-04-1990
		US 4980488 A	25-12-1990
		US 4988819 A	29-01-1991
		US 4990677 A	05-02-1991
		US 5034052 A	23-07-1991
		US 5097047 A	17-03-1992
EP 0087148 A1	31-08-1983	AR 227310 A1	15-10-1982
		AR 229527 A1	15-09-1983
		AT 25522 T	15-03-1987
		AU 542623 B2	28-02-1985
		AU 556515 B2	06-11-1986
		AU 560022 B2	26-03-1987
		AU 3629284 A	04-04-1985
		AU 3629384 A	04-04-1985
		AU 6945681 A	19-11-1981
		BR 8103049 A	09-02-1982
		CA 1341164 C	02-01-2001
		CA 1341521 C	06-03-2007
		DD 158847 A5	09-02-1983
		DD 205602 A5	04-01-1984
		DE 3164696 D1	16-08-1984
		DK 54185 A	06-02-1985
		DK 213081 A	17-11-1981
		EG 14836 A	30-06-1985
		EP 0040345 A1	25-11-1981
		EP 0072580 A2	23-02-1983
		EP 0087148 A1	31-08-1983
		ES 8203859 A1	16-07-1982
		FI 811472 A	17-11-1981
		GR 78229 A1	26-09-1984
		HU 188092 B	28-03-1986
		HU 191148 B	28-01-1987
		HU 191671 B	30-03-1987
		IE 52450 B1	11-11-1987
		IL 62863 A	31-08-1987
		JP 2167270 A	27-06-1990
		JP 2167273 A	27-06-1990
		JP 3072217 B	18-11-1991
		JP 4013349 B	09-03-1992

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2012/073427

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
		NL 971022 I1	01-10-1997
		NZ 197083 A	11-06-1986
		NZ 209126 A	11-06-1986
		OA 6809 A	31-12-1982
		PH 17636 A	18-10-1984
		PH 25782 A	05-11-1991
		PH 25843 A	02-12-1991
		PT 72979 A	01-06-1981
		TR 22042 A	05-02-1986
		TR 22396 A	23-03-1987
		TR 22400 A	31-03-1987
		TR 22691 A	31-03-1988
		US 4532341 A	30-07-1985
		US 4626595 A	02-12-1986
		US 4723984 A	09-02-1988
		US 4789672 A	06-12-1988
		US 4871390 A	03-10-1989
		US 4897107 A	30-01-1990
		US 4904298 A	27-02-1990
		US 4911746 A	27-03-1990
EP 0319481 A1	07-06-1989	AU 2639388 A	22-06-1989
		BR 8806379 A	22-08-1989
		CN 1033381 A	14-06-1989
		CS 8807909 A3	18-03-1992
		DE 3878186 D1	18-03-1993
		DE 3878186 T2	01-07-1993
		DK 669388 A	03-06-1989
		EP 0319481 A1	07-06-1989
		ES 2053808 T3	01-08-1994
		HU 203731 B	30-09-1991
		JP 1199952 A	11-08-1989
		NZ 227144 A	25-09-1991
		PT 89130 A	29-12-1989
		RU 2015971 C1	15-07-1994
		SU 1779248 A3	30-11-1992
		ZA 8809070 A	29-08-1990
US 4118461 A	03-10-1978	KEINE	

フロントページの続き

(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,BN,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,PA,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

(74)代理人 100146318
弁理士 岩瀬 吉和
(74)代理人 230105223
弁護士 城山 康文
(72)発明者 ヘルムケ, ヘンドリツク
ドイツ国、６５８３５・リーデルーバツハ、ザム・モーゲングラーベン・２２
(72)発明者 ホフマン, セバスチヤン
ドイツ国、４１４７０・ノイス、ツユプレツセンヴエーク・１２
(72)発明者 ニシング, カール・フリードリツヒ
ドイツ国、５１３８１・レバークーゼン、ヒユーシエンダー・シユトラーセ・３８・ツエー
(72)発明者 スダウ, アレキサンダー
ドイツ国、４０７６４・ランゲンフエルト、ロツハー・ヴェーグ・１７・エフ
(72)発明者 土屋 知己
フランス国、６９００９・リヨン、リユ・ジヤン・マリー・ルクレール・１６
(72)発明者 ベンテイング, ユルゲン
ドイツ国、４２７９９・ライヒリンゲン、アムゼルシユトラーセ・７
(72)発明者 ダーメン, ペーター
ドイツ国、４１４７０・ノイス、アルテブルツカー・シユトラーセ・６１
(72)発明者 ヴアツヘンドルフ－ノイマン, ウルリケ
ドイツ国、５６５６６・ノイヴイート、オーベラー・マーケンベーグ・８５
(72)発明者 ベルニエ, デイビツド
フランス国、エフ－６９００４・リヨン、ケ・ジヨゼフ・ジレ・３８
(72)発明者 ブリユネ, ステフアン
フランス国、０１３９０・サン・アンドレ・ド・コルシイ、リユ・デ・ドンブ・４４
(72)発明者 グロージヤン－クールノワイエ, マリー－クレール
フランス国、エフ－６９２５０・キユリ・オ・モンドール、ル・トレーブ・ルート・ダルビニー
(72)発明者 ラシエーズ, ヘレン
フランス国、エフ－６９００９・リヨン、シユマン・ド・モンペラ・１１
(72)発明者 リノルフイ, フイリツプ
フランス国、エフ－６９３８０・シヤテイヨン・ダゼルク、シユマン・ドユ・コトー・７

Ｆターム(参考) 4C063 AA01 BB01 CC71 DD25 EE03
4H011 AA01 BB09