

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

(11)公表番号

特表2025-505248

(P2025-505248A)

(43)公表日 令和7年2月21日(2025.2.21)

(51)国際特許分類	F I	テーマコード(参考)
A 0 1 N 47/24 (2006.01)	A 0 1 N 47/24	G 4 H 0 1 1
A 0 1 P 3/00 (2006.01)	A 0 1 P 3/00	4 H 0 6 1
A 0 1 N 25/04 (2006.01)	A 0 1 N 25/04	1 0 1
C 0 5 G 3/60 (2020.01)	A 0 1 N 25/04	1 0 2
	C 0 5 G 3/60	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全28頁)

(21)出願番号	特願2024-547547(P2024-547547)	(71)出願人	506352278
(86)(22)出願日	令和5年2月9日(2023.2.9)		クローダ インターナショナル パブリック
(85)翻訳文提出日	令和6年9月20日(2024.9.20)		ク リミティド カンパニー
(86)国際出願番号	PCT/IB2023/000148		イギリス国, ディーエヌ14 9エーエ
(87)国際公開番号	WO2023/152569		ー, イースト ヨークシャー, グール,
(87)国際公開日	令和5年8月17日(2023.8.17)		スネイス, コウィック ホール
(31)優先権主張番号	63/309,869	(74)代理人	100099759
(32)優先日	令和4年2月14日(2022.2.14)		弁理士 青木 篤
(33)優先権主張国・地域又は機関	米国(US)	(74)代理人	100123582
			弁理士 三橋 真二
(81)指定国・地域	AP(BW,CV,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,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	(74)代理人	100108903
	最終頁に続く		弁理士 中村 和広
		(74)代理人	100123593
			弁理士 関根 宣夫
		(74)代理人	100208225
			最終頁に続く

(54)【発明の名称】 農薬補助剤

(57)【要約】

ジケトピペラジンから選択される補助剤及び農薬活性物質を含む新規農薬製剤。製剤を形成するのに適した濃縮物も提供される。ジケトピペラジンは、濃縮物及び農薬製剤において補助活性を提供する。製剤を作製する方法も提供され、及び農薬製剤中の補助剤としての前記ジケトピペラジンの使用も提供される。ジケトピペラジンを形成する方法も記載される。ジケトピペラジンは、有害生物を防除するために植物を処置するための製剤又は種子コーティングにおいて使用され得る。

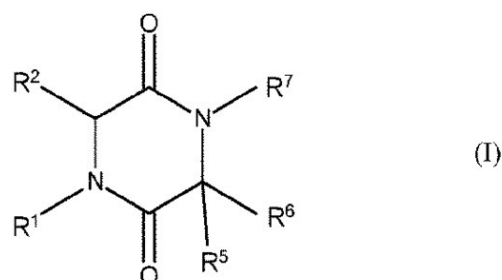
## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

農薬製剤であって、

i) 式 (I)

## 【化 1】



10

(式中、

$R^1$  は、水素又は  $C_1 \sim C_4$  アルキルを表し；

$R^2$  は、水素、 $C_1 \sim C_4$  アルキル又は  $-CH(R^3)(R^4)$  を表し；

$R^3$  及び  $R^4$  は、それぞれ独立して、水素、 $C_1 \sim C_3$  アルキル、フェニル又は置換フェニルを表し；

$R^5$  は、水素、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、ヒドロキシル、メトキシ又はエトキシを表し；

20

$R^6$  及び  $R^7$  は、それぞれ独立して、水素、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、ヒドロキシル、メトキシ、エトキシを表すか、又は  $R^6$  及び  $R^7$  は、合わせて、それぞれ結合された N 及び C 原子と共に、5 若しくは 6 員の任意選択で置換された飽和若しくは不飽和環を形成する直鎖  $C_3$  若しくは  $C_4$  連結基を表す)

によるジケトピペラジンから選択される補助剤；及び

ii) 少なくとも 1 つの農薬活性物質、栄養素又は生物刺激剤を含む農薬製剤。

## 【請求項 2】

$R^1$  は、水素、メチル又はエチルを表し；

$R^2$  は、水素又は  $-CH(R^3)(R^4)$  を表し；

30

$R^3$  及び  $R^4$  の少なくとも 1 つは、フェニルを表す一方、他方は、水素、メチル又はエチルを表し；

$R^5$  は、水素又はメチルを表し；

$R^6$  及び  $R^7$  は、それぞれ独立して、水素若しくは  $C_1 \sim C_4$  アルキルを表すか、又は  $R^6$  及び  $R^7$  は、合わせて、それぞれ結合された N 及び C 原子と共に、5 若しくは 6 員の任意選択で置換された飽和若しくは不飽和環を形成する直鎖  $C_3$  若しくは  $C_4$  連結基を表す、請求項 1 に記載の製剤。

## 【請求項 3】

$R^1$  は、水素又はメチルを表し；

$R^2$  は、水素又は  $-CH(R^3)(R^4)$  を表し；

40

$R^3$  及び  $R^4$  の少なくとも 1 つは、フェニルを表す一方、他方は、水素又はメチルを表し；

$R^5$  は、水素を表し；

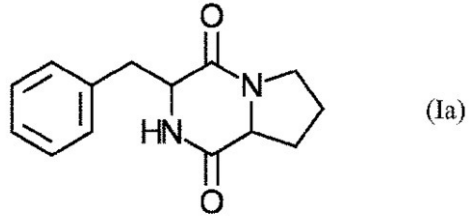
$R^6$  及び  $R^7$  は、それぞれ独立して、水素若しくはメチルを表すか、又は  $R^6$  及び  $R^7$  は、合わせて、 $n$ -プロピル、 $n$ -ブチル若しくは  $n$ -プロペニルから選択される直鎖  $C_3$  若しくは  $C_4$  連結基を表す、請求項 1 又は 2 に記載の製剤。

## 【請求項 4】

前記補助剤は、以下の式：

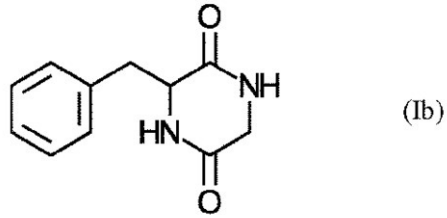
50

【化 2】

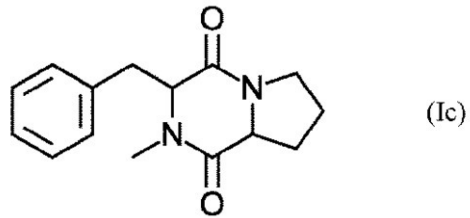


【化 3】

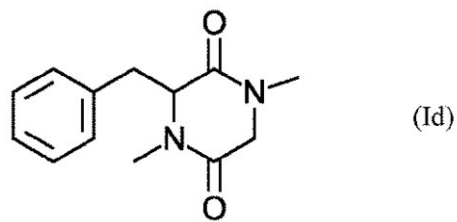
10



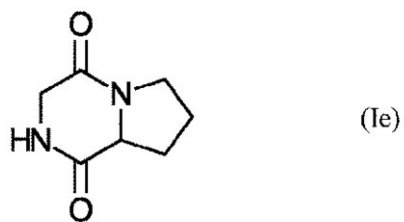
20



30

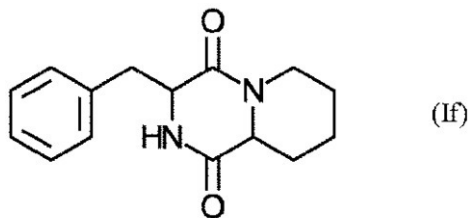


40

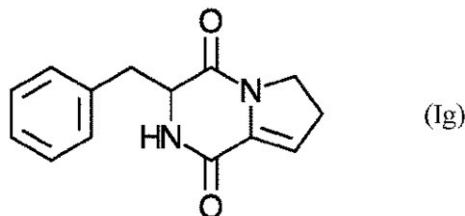


50

## 【化 4】



10



のジケトピペラジンから選択される、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の製剤。

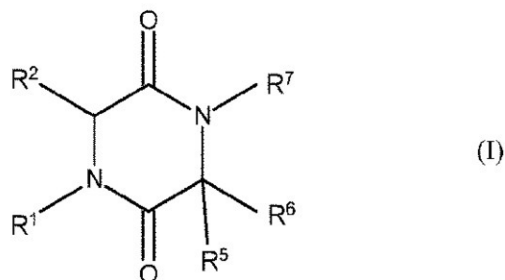
20

## 【請求項 5】

請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の農薬製剤を作製するのに適した濃縮製剤であって

i) 式 (I)

## 【化 5】



30

(式中、

R<sup>1</sup> は、水素又は C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルを表し；

R<sup>2</sup> は、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル又は -CH(R<sup>3</sup>)(R<sup>4</sup>) を表し；

R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> は、それぞれ独立して、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキル、フェニル又は置換フェニルを表し；

R<sup>5</sup> は、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、ヒドロキシル、メトキシ又はエトキシを表し；

40

R<sup>6</sup> 及び R<sup>7</sup> は、それぞれ独立して、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、ヒドロキシル、メトキシ、エトキシを表すか、又は R<sup>6</sup> 及び R<sup>7</sup> は、合わせて、それぞれ結合された N 及び C 原子と共に、5 若しくは 6 員の任意選択で置換された飽和若しくは不飽和環を形成する直鎖 C<sub>3</sub> ~ C<sub>4</sub> 連結基を表す)

によるジケトピペラジンから選択される補助剤；及び

ii) 少なくとも 1 つの農薬活性物質、栄養素又は生物刺激剤

を含む濃縮製剤。

## 【請求項 6】

乳化性濃縮物 (EC)、エマルジョン濃縮物 (EW)、懸濁濃縮物 (SC)、可溶性液体 (SL)、油ベースの懸濁濃縮物 (OD) 又はサスポエマルジョン (SE) である、請

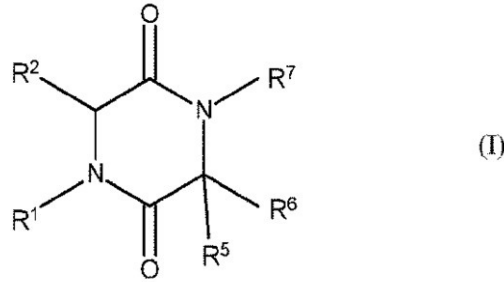
50

求項 5 に記載の濃縮製剤。

【請求項 7】

式 (I)

【化 6】



10

(式中、

R<sup>1</sup> は、水素又は C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルを表し；

R<sup>2</sup> は、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル又は -CH(R<sup>3</sup>)(R<sup>4</sup>)を表し；

R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> は、それぞれ独立して、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキル、フェニル又は置換フェニルを表し；

R<sup>5</sup> は、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、ヒドロキシル、メトキシ又はエトキシを表し；

R<sup>6</sup> 及び R<sup>7</sup> は、それぞれ独立して、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、ヒドロキシル、メトキシ、エトキシを表すか、又は R<sup>6</sup> 及び R<sup>7</sup> は、合わせて、それぞれ結合された N 及び C 原子と共に、5 若しくは 6 員の任意選択で置換された飽和若しくは不飽和環を形成する直鎖 C<sub>3</sub> ~ C<sub>4</sub> 連結基を表す)

20

によるジケトピペラジンから選択される化合物の、少なくとも 1 つの農薬活性物質、栄養素又は生物刺激剤を含む農薬製剤中の補助剤としての使用。

【請求項 8】

有害生物を防除するために植物を処置する方法であって、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の製剤又は請求項 5 若しくは 6 に記載の希釈された濃縮製剤を前記植物又は前記植物の周囲の環境のいずれかに適用することを含む方法。

【請求項 9】

請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載のジケトピペラジン補助剤を含む種子コーティング組成物。

30

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、概して、農薬活性製剤のための補助剤、及び 1 つ以上の農薬活性物質と共に前記補助剤を含む農薬製剤において補助活性を提供する方法に関する。本発明は、前記製剤で作物を処置することを含む。

【背景技術】

【0002】

補助剤は、一般に、農薬活性物質の生物学的活性又は有効性を改善することができる化学物質又は化学物質の混合物として定義される。補助剤自体は、有害生物を防除しないか又は死滅させない。代わりに、これらの添加剤は、標的生物内の分子標的（例えば、細胞壁、イオンチャネル、構造タンパク質、酵素等）と相互作用するか、又は農薬製剤のいくつかの特性（例えば、展着、保持、浸透、液滴サイズ）を修飾し、それにより生物に対する農薬活性物質の生物学的活性を改善し得る。補助剤として使用される化合物の典型的なタイプは、小分子、界面活性剤、乳化剤、油及び塩を含み得る。補助剤は、典型的には、処置された植物で活性物質の移動を阻害しない。加えて、補助剤は、植物に対して望ましくない植物毒性効果を生じさせるべきではない。

40

【0003】

50

真菌は、地球環境で広く見られ、農業生産性に対して大きい課題を呈する。野放しの真菌感染は、80%を超えることがある、収穫前及び後の作物の損失をもたらすことがある。そのような損失を低減することを促進し、且つ増加しつつある食糧需要に応えるために、真菌農業有害生物を防除するための殺真菌薬の使用は、農業有害生物管理システムの重要な構成要素であり、且つそうあり続けるであろう。

【0004】

農業有害生物、とりわけ真菌有害生物に対処するための新しい戦略を開発する必要がある。1つの戦略は、農業生産性に対する真菌有害生物の影響を予防するか又は低下させるために、野外及びビニールハウス作物に対する使用についてすでに承認されている既存の殺真菌薬の有効性を改善する、安全で無毒性の化学物質である補助剤を開発することである。これらの補助剤は、野外における又は収穫後の有害生物の防除を改善し、それにより生産性を増加させ得る。補助剤は、所望のレベルの有害生物防除を達成するのに必要とされる殺真菌薬の量も低減させ、したがって持続可能な生産性の増加を達成する目標に貢献し得る。

10

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0005】

本発明は、農薬活性物質と組み合わせた農薬製剤中での化合物の使用を提供することを目的とし、化合物は、活性物質の効力の改善を含む所望の補助活性を提供し得る。本発明は、前記補助剤を含む農薬濃縮物、希釈製剤及び種子コーティングの使用を提供することも目的とする。

20

【0006】

本発明は、農薬製剤中に化合物を提供することも目的とし、化合物は、既存の補助剤と比較して同等の又は改善された補助活性特性を提供し得る。

【0007】

本発明は、農薬製剤で補助活性を提供する際の使用のための、補助剤としての化合物及び前記化合物を含む製剤の使用を提供することも目的とする。

【課題を解決するための手段】

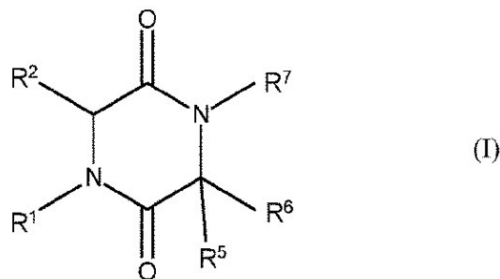
【0008】

本発明の第1の態様によれば、農薬製剤であって、

30

i) 式(I)

【化1】



40

(式中、

R<sup>1</sup> は、水素又はC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルを表し；

R<sup>2</sup> は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル又は-CH(R<sup>3</sup>)(R<sup>4</sup>)を表し；

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、それぞれ独立して、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル、フェニル又は置換フェニルを表し；

R<sup>5</sup>は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、ヒドロキシル、メトキシ又はエトキシを表し；

R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は、それぞれ独立して、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、ヒドロキシル、メトキシ、エトキシを表すか、又はR<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は、合わせて、それぞれ結合されたN及びC原子と共に、5若しくは6員の任意選択で置換された飽和若しくは不飽和環を形成する直鎖

50

C<sub>3</sub>若しくはC<sub>4</sub>連結基を表す)

によるジケトピペラジンから選択される補助剤；及び

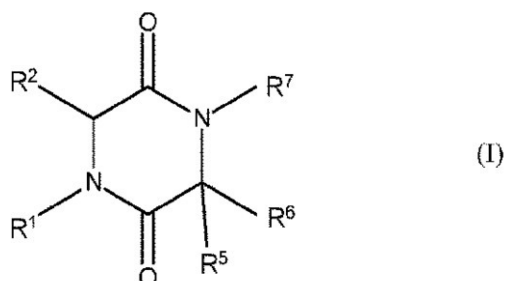
ii) 少なくとも1つの農薬活性物質、栄養素又は生物刺激剤を含む農薬製剤が提供される。

【0009】

本発明の第2の態様によれば、第1の態様の農薬製剤を作製するのに適した濃縮製剤であって、

i) 式(I)

【化2】



10

(式中、

R<sup>1</sup>は、水素又はC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルを表し；

R<sup>2</sup>は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル又は-CH(R<sup>3</sup>)(R<sup>4</sup>)を表し；

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、それぞれ独立して、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル、フェニル又は置換フェニルを表し；

R<sup>5</sup>は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、ヒドロキシル、メトキシ又はエトキシを表し；

R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は、それぞれ独立して、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、ヒドロキシル、メトキシ、エトキシを表すか、又はR<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は、合わせて、それぞれ結合されたN及びC原子と共に、5若しくは6員の任意選択で置換された飽和若しくは不飽和環を形成する直鎖C<sub>3</sub>~C<sub>4</sub>連結基を表す)

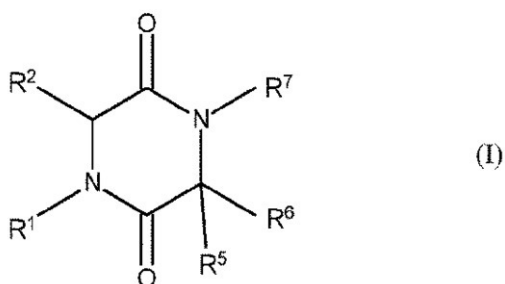
によるジケトピペラジンから選択される補助剤；及び

ii) 少なくとも1つの農薬活性物質、栄養素又は生物刺激剤を含む濃縮製剤が提供される。

【0010】

本発明の第3の態様によれば、式(I)

【化3】



40

(式中、

R<sup>1</sup>は、水素又はC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルを表し；

R<sup>2</sup>は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル又は-CH(R<sup>3</sup>)(R<sup>4</sup>)を表し；

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、それぞれ独立して、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル、フェニル又は置換フェニルを表し；

R<sup>5</sup>は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、ヒドロキシル、メトキシ又はエトキシを表し；

50

R<sup>6</sup> 及び R<sup>7</sup> は、それぞれ独立して、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル、ヒドロキシル、メトキシ、エトキシを表すか、又は R<sup>6</sup> 及び R<sup>7</sup> は、合わせて、それぞれ結合された N 及び C 原子と共に、5 若しくは 6 員の任意選択で置換された飽和若しくは不飽和環を形成する直鎖 C<sub>3</sub> ~ C<sub>4</sub> 連結基を表す)

によるジケトピペラジンから選択される化合物の、少なくとも 1 つの農薬活性物質、栄養素又は生物刺激剤を含む農薬製剤中の補助剤としての使用が提供される。

【0011】

本発明の第 4 の態様によれば、有害生物を防除するために植物を処置する方法であって、第 1 の態様の製剤又は第 2 の態様の希釈された濃縮製剤を前記植物又は前記植物の周囲の環境のいずれかに適用することを含む方法が提供される。

10

【0012】

本発明の第 5 の態様によれば、第 1 の態様による補助剤を含む種子コーティング組成物が提供される。

【発明を実施するための形態】

【0013】

本明細書で定義される化合物は、少なくとも 1 つの農薬活性物質、栄養素又は生物刺激剤を有する農薬製剤で使用される場合、所望の補助活性特性を提供することが分かっている。同定されたクラスのジケトピペラジン化合物は、本質的な殺虫性の活性を示さない。

【0014】

本明細書で使用されるように、用語「例えば (for example)」、「例を挙げると (for instance)」、「などの (such as)」又は「含む (including)」は、より概括的な主題をさらに明確にする例を導入することを意味する。他に指定のない限り、これらの例は、本開示で示される本出願を理解するための補助としてのみ提供され、決して限定を意味するものではない。

20

【0015】

置換基中の炭素原子の数を記載する場合 (例えば、「C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル」)、数は、あらゆる分岐した基に存在するあらゆる炭素原子を含む、置換基に存在する炭素原子の総数を指すことが理解されるであろう。加えて、例えば脂肪酸中の炭素原子の数を記載する場合、これは、カルボン酸の炭素原子及びあらゆる分岐した基に存在するあらゆる炭素原子を含む炭素原子の総数を指す。

30

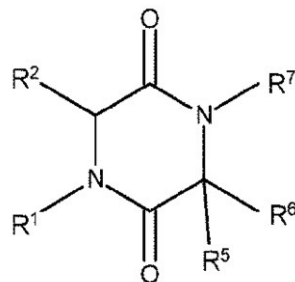
【0016】

ジケトピペラジン (DKP) は、2 つのアミド結合を有する有機アミド化合物である。

【0017】

本発明の補助剤は、式 (I)

【化 4】



(I)

40

(式中、

R<sup>1</sup> は、水素又は C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルを表し；

R<sup>2</sup> は、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル又は -CH(R<sup>3</sup>)(R<sup>4</sup>)を表し；

R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> は、それぞれ独立して、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>アルキル、フェニル又は置換フェニルを表し；

R<sup>5</sup> は、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル、ヒドロキシル、メトキシ又はエトキシを表し；及び

50

$R^6$  及び  $R^7$  は、それぞれ独立して、水素、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、ヒドロキシル、メトキシ、エトキシを表すか、又は  $R^6$  及び  $R^7$  は、合わせて、それぞれ結合された N 及び C 原子と共に、5 若しくは 6 員の任意選択で置換された飽和若しくは不飽和環を形成する直鎖  $C_3 \sim C_4$  連結基を表す)

の構造を有するジケトピペラジンから選択される。

【0018】

本明細書で使用される用語「 $C_1 \sim C_4$  アルキル」は、他に定義されない限り、直鎖又は分岐しており、1～4つの炭素原子を含有する飽和炭化水素ラジカルを指す。Rのいずれかが  $C_1 \sim C_4$  アルキルを表す場合、前記アルキルは、独立して、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル又は同種のものから選択され得る。好ましくは、メチル又はエチルである。より好ましくは、メチルである。

10

【0019】

本明細書で使用される用語「 $C_1 \sim C_3$  アルキル」は、他に定義されない限り、直鎖又は分岐しており、1～3つの炭素原子を含有する飽和炭化水素ラジカルを指す。Rのいずれかが  $C_1 \sim C_3$  アルキルを表す場合、前記アルキルは、独立して、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル又は同種のものから選択され得る。好ましくは、メチル又はエチルである。より好ましくは、メチルである。

【0020】

本明細書で使用される用語「ヒドロキシル」は、他に述べられない限り、構造 - O - H を有する1つの酸素及び1つの水素原子を含み、且つ酸素を介して隣のラジカルに結合するヒドロキシル基を指す。

20

【0021】

本明細書で使用される用語「メトキシ」及び「エトキシ」は、他に定義されない限り、それぞれ構造 - O -  $CH_3$  及び - O -  $CH_2CH_3$  を有するアルコキシラジカルを形成し、且つ酸素を介して隣のラジカルに結合する、酸素に連結されたメチル基及びエチル基を指す。

【0022】

本明細書で使用される用語「フェニル」は、他に定義されない限り、1つの水素の除去によってベンゼン芳香族炭化水素から誘導される  $C_6H_5$  有機ラジカルを指す。

30

【0023】

本明細書で使用される用語「置換フェニル」は、他に定義されない限り、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ又はハロで置換されるフェニルを指す。前記置換は、芳香環の任意の位置にあり得、オルト又はパラの位置が好ましい。

【0024】

本明細書で使用される用語「ハロ」は、他に定義されない限り、周期表のVII族(17族)における元素から誘導されるハライドラジカルを指す。ハライドラジカルは、独立して、フルオロ、クロロ、プロモ又はヨードから選択され得る。好ましくは、クロロである。

【0025】

好ましくは、 $R^1$  は、水素、メチル又はエチルを表す。より好ましくは、水素又はメチルである。

40

【0026】

好ましくは、 $R^2$  は、水素又は -  $CH(R^3)(R^4)$  を表す。

【0027】

$R^2$  が -  $CH(R^3)(R^4)$  を表す場合、好ましくは、 $R^3$  及び  $R^4$  は、それぞれ独立して、水素、メチル、フェニル又は置換フェニルを表し、置換基は、メチル、エチル、メトキシ又はエトキシである。より好ましくは、水素又はフェニルである。

【0028】

好ましくは、 $R^3$  及び  $R^4$  の少なくとも1つは、フェニルを表す一方、他方は、水素、

50

メチル又はエチルを表す。より好ましくは、 $R^3$ 及び $R^4$ の一方は、フェニルを表し、他方は、水素又はメチルを表す。最も好ましくは、 $R^3$ 及び $R^4$ の一方は、フェニルを表し、他方は、水素を表す。

## 【0029】

好ましくは、 $R^5$ は、水素又はメチルを表す。より好ましくは、水素である。

## 【0030】

$R^6$ 及び $R^7$ は、独立して、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、ヒドロキシル、メトキシ又はエトキシを表す。好ましくは、水素又は $C_1 \sim C_4$ アルキルである。より好ましくは、水素又はメチルである。さらに好ましくは、水素である。特に好ましくは、 $R^6$ 及び $R^7$ の両方は、水素であるか、又は $R^6$ は、メチルであり、 $R^7$ は、水素である。

10

## 【0031】

代替実施形態では、 $R^6$ 及び $R^7$ は、合わせて、単一の基を形成し、直鎖 $C_3 \sim C_4$ 連結基を表す。 $R^6$ 及び $R^7$ が結合する、隣接するN及びC原子と共に、これは、5又は6員の任意選択で置換された環を形成し、これは、飽和又は不飽和環であり得る。

## 【0032】

前記直鎖 $C_3 \sim C_4$ 連結基は、アルキル又はアルケニルから選択され得、好ましくはn-プロピル、n-ブチル、n-プロペニル又はn-ブテニルから選択され得る。好ましくは、n-プロピル、n-ブチル又はn-プロペニルである。

## 【0033】

前記実施形態で形成される5又は6員環は、そのため、ピロリジン、ピペリジン、ピロリン、ピロール又はピリジンから選択され得る。好ましくは、ピロリジン、ピペリジン又はピロリンである。

20

## 【0034】

5又は6員環は、任意選択で置換され、本明細書で使用される用語は、環が置換又は非置換であり得ることを意味する。5又は6員環は、そのため、炭素主鎖上に1つ以上の置換基を含み得、前記置換基は、独立して、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、ヒドロキシル、メトキシ又はエトキシを表し得る。前記置換基は、本明細書で定義される通りである。

## 【0035】

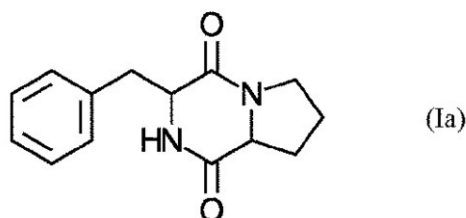
式(I)の化合物は、ピロリジン環の2位の炭素周辺で光学異性化を有し得る。R及びS異性体の両方が式(I)のジケトピペラジンの定義に含まれることが理解されるであろう。特に、S異性体が好ましい場合がある。

30

## 【0036】

特に、以下から選択されるジケトピペラジンが好ましい場合がある。

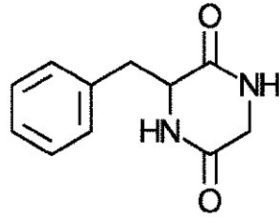
## 【化5】



40

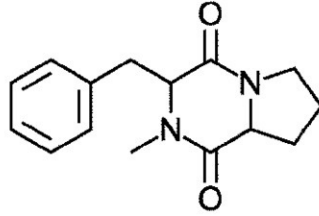
50

【化 6】



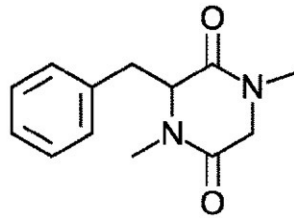
(1b)

10



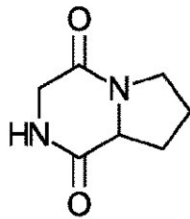
(1c)

20



(1d)

30

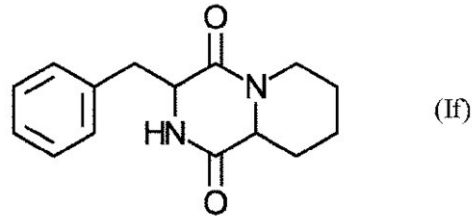


(1e)

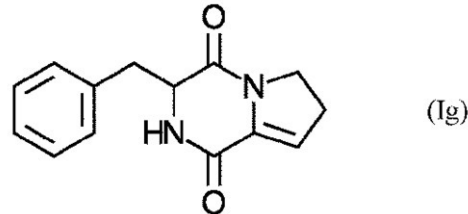
40

50

## 【化 7】



10



## 【0037】

いかなる特定の方法論によっても束縛されることを望まないが、ジケトピペラジンは、合成技術によって形成され得る。

20

## 【0038】

ジケトピペラジン及びその誘導体は、市販の材料及び科学文献に記載される合成方法論を使用して、有機化学の当業者によって化学合成を通して生成され得る。

## 【0039】

1つのそのような方法は、カルボジイミド又はホスホニウムベースのカップリング試薬を使用するフェニルプロピオール酸とL-プロリンアミドとの間のアミドカップリング反応で始まる二段階合成である。トリフェニルホスフィンによって触媒される求核性の - 付加を通じたその後の分子内環化は、式(I)の所望のジケトピペラジンをもたらす。第3のステップは、次いで、塩基の存在下でヨードメタンを使用するアミドのメチル化によって行われ得、メチル化されたバリエーションは、(Ic)又は(Id)などのように所望される。

30

## 【0040】

本発明の補助剤は、発酵ベースのプロセスを使用して微生物によっても形成され得る。

## 【0041】

補助剤自体の特性は、前記補助剤を含む農薬製剤に対して同じ有利な利点を提供することが理解される。そのため、本発明の補助剤を含む場合、補助剤自体の特性の利点を有する農薬製剤が提供される。

## 【0042】

殺虫薬及び殺真菌薬を含む農芸化学的活性化合物は、活性化合物が植物/標的生物によって吸収されることを可能にする製剤を必要とする。

40

## 【0043】

本明細書で使用される用語「農薬製剤」は、活性な農薬を含む組成物を指し、濃縮物及びスプレー製剤を含む組成物のすべての形態を含むことが意図される。特に述べられない場合、本発明の農薬製剤は、濃縮物、希釈された濃縮物又はスプレー可能な製剤の形態であり得る。

## 【0044】

本発明の補助剤は、少なくとも1つの農薬活性物質を含む農薬製剤を形成するために他の構成要素と組み合わせられ得る。

## 【0045】

50

したがって、農薬活性化合物は、乳化性濃縮物（EC）、エマルジョン濃縮物（EW）、懸濁濃縮物（SC）、可溶性液体（SL）として、油ベースの懸濁濃縮物（OD）として及び／又はサスポエマルジョン（SE）として製剤化され得る。

【0046】

EC製剤及びSL製剤では、活性化合物は、溶解された形態で存在し得るのに対して、OD、SC、EW又はSE製剤では、活性化合物は、固体又は乳化された液体として存在し得る。

【0047】

本発明の補助剤は、EC、EW、SC、SL、OD又はSE製剤において特に使用を見出すであろうことが想定される。

【0048】

農薬濃縮物は、農薬組成物であり、これは、水溶性又は非水溶性であり得、これは、対応するスプレー製剤を形成するために水（又は水ベースの液体）によって希釈されるように設計される。前記組成物は、液体状態（溶液、エマルジョン又は分散液など）及び顆粒又は粉末などの固体形態（とりわけ水分散性の固体形態）のものを含む。

【0049】

スプレー製剤は、植物又はその環境に適用することが所望されるすべての構成要素を含む水溶性の農薬製剤である。スプレー製剤は、所望の構成要素（水以外の）を含有する濃縮物の単純な希釈、又は個々の構成要素を混合すること、又は濃縮物の希釈及びさらなる個々の構成要素若しくは構成要素の混合物の追加の組み合わせによって作製され得る。典型的には、そのような最終的な使用時の混合は、製剤をスプレーするタンク中又は代わりにスプレータンクを充填するための一時保存タンク中で実行される。そのような混合及び混合物は、典型的には、タンク混合及びタンク混合物と称される。

【0050】

補助剤は、そのため、農薬活性化合物の製剤に組み込まれ得る（缶入り／一体型製剤）か、又はスプレー液の濃縮された製剤の希釈後に添加され得る（タンクミックス）。計量の誤りを回避し、且つ農薬製品の適用中の使用者の安全性を改善するために、補助剤を製剤に組み込むことが有利である。これは、タンクミックス製品についての追加の包装材料の不必要な使用も回避する。

【0051】

顧客の必要に従い、このようにして形成される濃縮物は、典型的には、95重量%までの農薬活性物質を含み得る。前記濃縮物は、使用のために希釈され、約0.5重量%～約1重量%の農薬活性濃度を有する希釈組成物をもたらし得る。前記希釈組成物（例えば、スプレー散布量が $10 \sim 500 \text{ l} \cdot \text{ha}^{-1}$ であり得るスプレー製剤）では、農薬活性濃度は、スプレーされる全製剤の約0.001重量%～約1重量%の範囲であり得る。

【0052】

本発明の補助剤は、典型的には、製剤中の活性な農薬の量に比例した量で使用される。農薬製剤濃縮物では、補助剤の割合は、液体キャリア中での構成要素の溶解度によるであろう。典型的には、そのような濃縮物中の補助剤の濃度は、1重量%～99重量%である。好ましくは、1重量%～70重量%である。より好ましくは、3重量%～50重量%である。

【0053】

例えば、スプレー製剤を形成するための希釈に際して、補助剤は、典型的には、0.01重量%～2重量%、より通常には0.03重量%～0.5重量%のスプレー製剤の濃度で存在する。さらに好ましくは、0.12重量%～0.4重量%のスプレー製剤である。

【0054】

農薬製剤中の補助剤と活性な農薬の比は、好ましくは、約1:40～約1:1である。より好ましくは、約1:20～約1:1である。さらに好ましくは、約1:5～約1:1である。この比の範囲は、一般に、製剤の濃縮形態（例えば、補助剤が分散性液体濃縮物又は分散性固体顆粒製剤中に含まれる）のために及びスプレー製剤で維持される。

10

20

30

40

50

## 【0055】

濃縮物（固体又は液体）が活性な農薬及び／又は補助剤の供給源として使用される場合、濃縮物は、典型的には、スプレー製剤を形成するために希釈される。希釈は、スプレー製剤を形成するために、濃縮物の総重量の1～10,000、詳細には10～1,000倍の水によるものであり得る。

## 【0056】

固体粒子として水溶性の最終的に使用される製剤中に農薬活性物質が存在する場合、最も通常には、農薬活性物質は、主に活性な農薬である粒子として存在する。しかしながら、必要に応じて、活性な農薬は、固体キャリア、例えばシリカ又は珪藻土上に支持され得、これは、上記に言及されるように固体支持体、充填材又は希釈材料であり得る。

10

## 【0057】

スプレー製剤は、典型的には、中程度に酸性（例えば、約3）～中程度にアルカリ性（例えば、約10）の範囲内及び特に中性近く（例えば、約5～8）のpHを有するであろう。より濃縮された製剤は、同様の酸性度／アルカリ性度を有するが、それらは、ほとんど非水溶性であるため、pHは、必ずしもこの適切な基準ではない。

## 【0058】

農薬製剤は、補助剤と関連する、モノプロピレングリコール、スプレーオイル（非界面活性補助剤としてスプレー製剤中に含まれる油）などの植物油又は鉱油であり得る油などの溶媒（水以外の）を含み得る。そのような溶媒は、補助剤のための溶媒及び／又は保湿剤、例えばとりわけプロピレングリコールとして含まれ得る。使用される場合、そのような溶媒は、典型的には、補助剤の重量に関して5重量%～500重量%、望ましくは10重量%～100重量%の量で含まれる。そのような組み合わせは、塩化アンモニウム及び／若しくは安息香酸ナトリウムなどの塩並びに／又はとりわけゲル阻害の補助としての尿素も含み得る。

20

## 【0059】

代替実施形態では、本発明の補助剤は、種に適用するのに適した種子コーティング組成物中に含まれ得る。好ましくは、本発明の補助剤は、種子コーティング組成物中に含まれ得る。

## 【0060】

補助剤は、適切には、組成物の総重量に基づいて0.5～25重量%、好ましくは2～18重量%、より好ましくは5～15重量%、特に8～12重量%の範囲における濃度で種子コーティング組成物中に存在する。

30

## 【0061】

コーティングは、当技術分野で知られているように、フィルムコーティング、ペレットリング及び外皮形成又はこれらの技術の組み合わせを含み得る。本発明は、前記コーティングタイプのすべて、好ましくはフィルムコーティングに適用されることが想定される。

## 【0062】

本発明の種子コーティング組成物は、従来の方法で種子に適用され得る。

## 【0063】

種子は、プライミングされても又はプライミングされなくてもよい（発芽率を改善するための処置、例えばオスモプライミング、ハイドロプライミング、マトリックスプライミングにかけられている）。

40

## 【0064】

一実施形態では、種子は、本発明の種子コーティング組成物を適用する前に、人工的な層、例えばポリマーなどのバインダーを含むプライマー層を提供されない。したがって、種子コーティング組成物は、好ましくは、種子の天然の外表面に直接適用される。それにもかかわらず、種子表面は、種子コーティング組成物を適用する前に表面処置を受けていることが可能である。

## 【0065】

好ましくは、種子コーティング組成物は、液体組成物、及び／又はエマルション、及び

50

ノ又は分散液、及びノ又はラテックス組成物として適用され、その後、凝固（硬化及びノ又は乾燥を含む）されて種子コーティングが形成される。本出願で使用される用語「液体コーティング組成物」は、懸濁液、エマルジョン及びノ又は分散液、好ましくは分散液の形態のコーティング組成物を含むことを意味する。

【0066】

コーティングの従来手段が種子をコーティングするために用いられ得る。種々のコーティング機が当業者に利用可能である。いくつかのよく知られている技術は、ドラムコーター、流動床技術、回転式コーター（乾燥と一体化した及び一体化していない）及び噴流層の使用を含む。適切には、種子コーティング組成物は、回転式コーター、回転式乾燥コーター、パンコーター又は連続処置装置によって種子に適用される。

10

【0067】

種子コーティング組成物は、例を挙げると、種子コーティング組成物のフィルムコーティング、スプレー、浸漬又はブラッシングによって適用され得る。好ましくは、方法は、フィルム又は種子コーティング層を形成するために種子コーティング組成物を適用することを含む。

【0068】

種子コーティングは、典型的には、種子の表面において、確実に接着している透湿性のコーティングを形成することを含む。プロセスは、典型的には、植え付け前に種子に液体種子コーティング組成物を適用することを含む。

【0069】

追加のフィルムコート層は、任意選択で、化粧、被度、活性物質、栄養素及びより速い乾燥、種子流動性、耐久性などの処理改善並びに同種のものを含むが、これらに限定されない追加の利益を提供するために、本発明のコーティング層の上に適用され得る。

20

【0070】

農薬製剤又は種子コーティング組成物は、必要に応じて他の構成要素を含み得る。これらの他の構成要素は、以下を含むものから選択され得る：

- ・バインダー、特に容易に水に溶けて高バインダー濃度で低粘度溶液を与えるバインダー、例えばポリビニルピロリドン；ポリビニルアルコール；カルボキシメチルセルロース；アラビアゴム；糖、例えばスクロース又はソルビトール；デンプン；エチレン酢酸ビニルコポリマー、スクロース及びアルギン酸、
- ・希釈剤、吸収剤又はキャリア、例えばカーボンブラック；タルク；珪藻土；カオリン；アルミニウム、カルシウム又はステアリン酸マグネシウム；トリポリリン酸ナトリウム；四ホウ酸ナトリウム；硫酸ナトリウム；ナトリウム、アルミニウム及び混合ケイ酸アルミニウムナトリウム；並びに安息香酸ナトリウム、
- ・崩壊剤、例えば界面活性剤、水中で膨張する材料、例えばカルボキシメチルセルロース、コロジオン、ポリビニルピロリドン及び結晶セルロース膨潤剤；塩、例えば酢酸ナトリウム又はカリウム、炭酸、重炭酸又はセスキ炭酸ナトリウム、硫酸アンモニウム及びリン酸水素二カリウム；
- ・湿潤剤、例えばアルコールエトキシレート及びアルコールエトキシレート/プロポキシレート湿潤剤；
- ・分散剤、例えばスルホン化ナフタレンホルムアルデヒド縮合物及びアクリル共重合体、例えばポリアクリル酸主鎖上にキャップされたポリエチレングリコール側鎖を有するコムコポリマー；
- ・乳化剤、例えばアルコールエトキシレート、ABAブロックコポリマー又はヒマシ油エトキシレート；
- ・典型的に製剤の0.005重量%～10重量%の量の消泡剤、例えばポリシロキサン消泡剤；
- ・粘度調整剤、例えば市販の水に溶ける又は混和性のゴム、例えばキサンタンガム及びノ又はセルロース誘導体、例えばカルボキシ-メチル、エチル又はプロピルセルロース；及びノ又は

30

40

50

・防腐剤及び/又は抗菌物質、例えば有機酸又はそれらのエステル若しくは塩、例えばアスコルビン酸、例えばパルミチン酸アスコルビル、ソルビン酸、例えばソルビン酸カリウム、安息香酸性の、例えば安息香酸並びに4-ヒドロキシ安息香酸メチル及びプロピル、プロピオン酸、例えばプロピオン酸ナトリウム、フェノール、例えばナトリウム2-フェニルフェナート；1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン；又はホルムアルデヒド自体若しくはパラホルムアルデヒドとして；又は典型的に製剤の0.01重量%~1重量%の量の無機材料、例えば亜硫酸及びその塩。

【0071】

本発明による農薬製剤又は種子コーティング組成物は、乳化剤系の一部を形成する界面活性材料などの構成要素も含有し得る。前記界面活性剤は、界面活性分散剤を含み得る。

10

【0072】

界面活性補助剤など、本発明の範囲内の他の補助剤は、本発明の組成物及び製剤中に含まれ、且つ本発明で使用され得る。例として、アルキル多糖（より正確にはアルキルオリゴ糖と呼ばれる）；脂肪アミンエトキシレート、例えばココナツアルキルアミン2EO；並びにアルキル（アルケニル）無水コハク酸の誘導体、特に、PCT出願国際公開第94/00508号パンフレット及び国際公開第96/16930号パンフレットに記載されるものを含む。

【0073】

製剤/組成物は、1つ以上の生物学的有効成分を含み得る（植物促進剤、特に植物保護製品（PPPとも称される）を含む）。有効成分、特に植物促進剤の適した例は、殺真菌剤、殺菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、殺軟体動物剤、生物学的製剤、殺ダニ剤又はダニ駆除剤、駆除薬及び殺生物剤である。さらに可能な有効成分は、消毒薬、微生物、げっ歯動物を殺す薬剤、除草剤（除草薬）、誘引剤、（鳥）忌避剤、植物成長調節物質（ジベレリン酸、オーキシシン又はサイトカイニンなど）、栄養素（硝酸カリウム、硫酸マグネシウム、鉄キレート剤など）、植物ホルモン、ミネラル、植物抽出物、発芽刺激薬、フェロモン、生物学的調製物等を含む。

20

【0074】

本発明による製剤又は種子コーティング組成物中での使用のための適した農薬活性物質は、室温で固体又は液体であり得るすべての農芸化学的活性化合物である。本発明の補助剤は、すべてのタイプの農薬活性物質に対して広い適用性を有するであろうことが想定される。

30

【0075】

農薬活性物質は、本発明に関して、植物保護剤、医療、農業、林業及び蚊の防除などの野外で使用される、様々な形態の生体を死滅させることができるより特定の化学物質である殺生物剤を指す。いわゆる植物成長調節物質も殺生物剤のグループにカウントされる。

【0076】

本発明の農薬製剤又は種子コーティング組成物中での使用のための殺生物剤は、典型的には、2つのサブグループに分けられる：

- ・殺真菌薬、除草薬、殺虫薬、殺藻剤、軟体動物駆除剤、ダニ駆除剤及び殺鼠剤を含む駆除薬、及び
- ・殺菌薬、抗生物質、抗菌薬、抗ウイルス薬、抗真菌薬、抗原虫薬及び抗寄生虫薬を含む抗菌物質。

40

【0077】

特に、殺虫薬、殺真菌薬又は除草薬から選択される殺生物剤が特に好ましい場合がある。

【0078】

用語「駆除薬」は、任意の有害生物を予防するか、破壊するか、忌避するか又は弱めることが意図される任意の物質又は物質の混合物を指すことが理解されるであろう。駆除薬は、食物についてヒトと競合するか、所有物を破壊するか、疾患を広げるか又は有害物である、昆虫、植物病原体、雑草、軟体動物、鳥、哺乳動物、魚、線形動物（回虫）及び病

50

原菌を含む有害生物に対して使用される化学物質又は生物学的薬剤（ウイルス若しくは細菌など）であり得る。以下の実施例では、本発明による農薬組成物に適した駆除薬が示される。

【0079】

殺真菌薬は、真菌を化学的に防除するものである。殺真菌薬は、庭及び作物で真菌の広がりを予防するために使用される化学的化合物である。殺真菌薬は、真菌感染を抑えるためにも使用される。殺真菌薬は、接触性又は浸透移行性であり得る。接触性殺真菌薬は、真菌が、葉表面に保持された殺真菌薬と接触すると真菌を死滅させる。浸透移行性殺真菌薬は、植物組織に吸収され、真菌が宿主に侵入しようとしたときに真菌を死滅させる。

【0080】

本発明による適した殺真菌薬の例は、以下の種を含む：（3 - エトキシプロピル）水銀プロミド、2 - メトキシエチル水銀塩化物、2 - フェニルフェノール、8 - 硫酸ヒドロキシキノリン、8 - フェニル水銀オキシキノリン、アシベンゾラル、アシルアミノ酸殺真菌薬、アシベタックス、アルジモルフ、脂肪族窒素殺真菌薬、アリルアルコール、アミド殺真菌薬、アムプロピルホス、アニラジン、アニリド殺真菌薬、抗生物質殺真菌薬、芳香族殺真菌薬、アウレロファンジン、アザコナゾール、アジチラム、アゾキシストロピン、バリウムポリスルフィド、ベナラキシル - M、ベノダニル、ベノミル、ベンキノックス、ベントルロン、ベンチアパリカルブ、塩化ベンザルコニウム、ベンザマクリル、ベンズアミド殺真菌薬、ベンザモルフ、ベンズアニリド殺真菌薬、ベンゾイミダール殺真菌薬、ベンゾイミダール前駆体殺真菌薬、ベンゾイミダゾリルカルバマート殺真菌薬、ベンゾヒドロキサム酸、ベンゾチアゾール殺真菌薬、ベソキサジン、ピナプアクリル、ピフェニル、ピテルタノール、ピチオノール、プラストサイジン - S、ボルドー液、ボスカリド、架橋ジフェニル殺真菌薬、プロムコナゾール、ブピリメート、バーガンディー液混合物、ブチオベート、ブチルアミン、カルシウムポリスルフィド、カプタホール、カプタン、カルバマート殺真菌薬、カルバモルフ、カルバニラート殺真菌薬、カルベンダジム、カルボキシシン、カルプロパミド、カルボン、チェシャント混合物、キノメチオナート、クロベンチアゾン、クロラニホルメタン、クロラニル、クロルフェナゾール、クロロジニトロナフタレン、クロロネブ、クロロピクリン、クロロタロニル、クロルキノックス、クロゾリネート、シクロピロックス、クリンバゾール、クロトリマゾール、コナゾール殺真菌薬、コナゾール殺真菌薬（イミダゾール）、コナゾール殺真菌薬（トリアゾール）、酢酸銅（II）、炭酸銅（II）、塩基性銅殺真菌薬、水酸化銅、ナフテン酸銅、オレイン酸銅、オキシ塩化銅、硫酸銅（II）、硫酸銅、塩基性クロム酸銅亜鉛、クレゾール、クフラネブ、クプロバム、亜酸化銅、シアゾファミド、シクラフラミド、環状ジチオカルバマート殺真菌薬、シクロヘキシミド、シフルフェナミド、シモキサニル、シベンダゾール、シプロコナゾール、シプロジニル、ダゾメット、DBCP、デバカルブ、デカフェンチン、デヒドロ酢酸、ジカルボキシイミド殺真菌薬、ジクロフルアニド、ジクロロン、ジクロロフェン、ジクロロフェニル、ジカルボキシイミド殺真菌薬、ジクロゾリン、ジクロブトラゾール、ジクロシメット、ジクロメジン、ジクロラン、ジエトフェンカルブ、ピロ炭酸ジエチル、ジフェノコナゾール、ジフルメトリム、ジメチリモール、ジメトモルフ、ジモキシストロピン、ジニコナゾール、ジニトロフェノール殺真菌薬、ジノブトン、ジノカップ、ジノクトン、ジノペントン、ジノスルホン、ジノテルボン、ジフェニルアミン、ジピリチオン、ジスルフィラム、ジタリムホス、ジチアノン、ジチオカルバマート殺真菌薬、DNOC、ドデモルフ、ドジシン、ドジン、ドナトジン、ドラゾキソロン、エジフェンホス、エポキシコナゾール、エタコナゾール、エテム、エタボキサム、エチリモール、エトキシキン、エチル水銀2, 3 - ジヒドロキシプロピルメルカプチド、エチル水銀アセタート、エチル水銀プロミド、塩化エチル水銀、エチル水銀ホスファート、エトリジアゾール、ファモキサドン、フェナミドン、フェナミノスルフ、フェナパニル、フェナリモル、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェンヘキサミド、フェニトロパン、フェノキサニル、フェンピクロニル、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、フェンチン、フェルバム、フェリムゾン、フルアジナム、フルジオキソニル、フルメトベル、フルピコリド、フルオロイミド、フ

10

20

30

40

50

ルオトリマゾール、フルオキサストロピン、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルスルファミド、フルトラニル、フルトリアホル、ホルベト、ホルムアルデヒド、ホセチル、フベリダゾール、フララキシル、フラメトピル、フラミド殺真菌薬、フルアニリド殺真菌薬、フルカルバニル、フルコナゾール、フルコナゾール - シス、フルフラール、フルメシクロックス、フロファネート、グリオジン、グリセオフルピン、グアザチン、ハラクリナート、ヘキサクロロベンゼン、ヘキサクロロブタジエン、ヘキサクロロフェン、ヘキサコナゾール、ヘキシルチオホス、ヒドラ-ガフェン、ヒメキサゾール、イマザリル、イミベンコナゾール、イミダゾール殺真菌薬、イミノクタジン、無機殺真菌薬、無機水銀殺真菌薬、ヨードメタン、イブコナゾール、イプロベンホス、イプロジオン、イプロバリカルブ、イソプロチオラン、イソバレジオン、カスガマイシン、クレソキシムメチル、石灰硫黄合剤、マンカップー、マンコゼブ、マネブ、メベニル、メカルピンジド、メパニピリム、メプロニル、塩化第二水銀、酸化第二水銀、塩化第一水銀、水銀殺真菌薬、メタラキシル、メタラキシル - M、メタム、メタゾキシロン、メトコナゾール、メタスルホカルブ、メトフロキサム、臭化メチル、イソチオシアン酸メチル、メチル水銀ベンゾアート、メチル水銀ジシアンジアミド、メチル水銀ペンタクロロフェノキシド、メチラム、メトミノストロピン、メトラフェノン、メトスルホバックス、ミルネブ、モルホリン殺真菌薬、ミクロブタニル、ミクロゾリン、N - (エチル水銀) - p - トルエンスルホンアニリド、ナバム、ナタマイシン、ニトロスチレン、ニトロタールイソプロピル、ヌアリモル、O C H、オクチリノン、オフラセ、有機水銀殺真菌薬、有機リン殺真菌薬、有機スズ殺真菌薬、オリサストロピン、オキサジキシル、オキサチン殺真菌薬、オキサゾール殺真菌薬、オキシシン銅、オキスポコナゾール、オキシカルボキシ、ペフラゾエート、ペンコナゾール、ペンシクロン、ペンタクロロフェノール、ペンチオピラド、フェニル水銀尿素、酢酸フェニル水銀、塩化フェニル水銀、ピロカテコールのフェニル水銀誘導体、硝酸フェニル水銀、サリチル酸フェニル水銀、フェニルスルホンアミド殺真菌薬、ホスジフェン、フタリド、フタルイミド殺真菌薬、ピコキシストロピン、ピペラリン、ポリカルバマート、高分子ジチオカルバマート殺真菌薬、ポリオキシ、ポリオキシリム、ポリスルフィド殺真菌薬、アジ化カリウム、多硫化カリウム、チオシアン酸カリウム、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパモカルブ、プロピコナゾール、プロピネブ、プロキナジド、プロチオカルブ、プロチオコナゾール、ピラカルボリド、ピラクロストロピン、ピラゾール殺真菌薬、ピラゾホス、ピリジン殺真菌薬、ピリジニトリル、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピリミジン殺真菌薬、ピロキロン、ピロキシクロル、ピロキシフィア、ピロール殺真菌薬、キナセトール、キナザミド、キンコナゾール、キノリン殺真菌薬、キノン殺真菌薬、キノキサリン殺真菌薬、キノキシフェン、キントゼン、ラベンザゾール、サリチルアニリド、シルチオファミン、シメコナゾール、アジ化ナトリウム、オルトフェニルフェノールナトリウム、ナトリウムペンタクロロフェノキシド、多硫化ナトリウム、スピロキサミン、ストレプトマイシン、ストロビルリン殺真菌薬、スルホンアニリド殺真菌薬、硫黄、スルトロペン、T C M T B、テブコナゾール、テクロフタラム、テクナゼン、テコラム、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チアジフルオール、チアゾール殺真菌薬、チシオフェン、チフルザミド、チオカルバマート殺真菌薬、チオクロルフェンフィム、チオメルサール、チオファナート、チオファネートメチル、チオフェン殺真菌薬、チオキノックス、チラム、チアジニル、チオキシミド、チベド、トルクロホスメチル、トルナフタート、トリルフルアニド、酢酸トリル水銀、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアミホス、トリアリモル、トリアズブチル、トリアジン殺真菌薬、トリアゾール殺真菌薬、トリアゾキシド、トリブチルスズオキシド、トリクラミド、トリシクラゾール、トリフロキシストロピン、トリフルミゾール、トリホリン、トリチコナゾール、未分類の殺真菌薬、ウンデシレン酸、ウニコナゾール、尿素殺真菌薬、バリダマイシン、バリンアミド殺真菌薬、ピンクロゾリン、ザリラミド、ナフテン酸亜鉛、ジネブ、ジラム、ゾキサミド及びその混合物。

## 【 0 0 8 1 】

除草薬は、望ましくない植物を死滅させるために使用される駆除薬である。選択的除草

10

20

30

40

50

薬は、所望の作物を比較的無害のままにしながら、特定の標的を死滅させる。これらの一部は、雑草の成長に干渉することによって作用し、植物ホルモンをベースとすることが多い。荒れた土地をきれいにするために使用される除草薬は、非選択的であり、除草薬が接触するすべての植物性材料を死滅させる。除草薬は、農業において及び庭園芝生管理で広く使用されている。それらは、高速道路及び鉄道の維持のために総合的植生管理（TVC）プログラムで適用される。森林、放牧地及び野生生物の生息地として残されたエリアの管理に使用される量は、より少ない。

【0082】

適した除草薬は、以下を含む群から選択され得る：アリアルオキシカルボン酸、例えば MCPA、アリアルオキシフェノキシプロピオン酸、例えばクロジナホップ、シクロヘキサジオンオキシム、例えばセトキシジム、ヒドロキシベンゾニトリル、例えばプロモキシニル、スルホニル尿素、例えばニコスルフロン、トリアゾロピリミジン、例えばペノキスラム、トリケチオン、例えばメソトリオン、メトリブジン、ヘキサジノン若しくはアトラジンなどのトリアジン除草薬；クロルスルフロンなどのスルホニル尿素除草薬；レナシル、プロマシル若しくはテルバシルなどのウラシル；リニュロン、ジウロン、シズロン若しくはネブロンなどの尿素除草薬；アラクロール若しくはメトラクロールなどのアセトアニリド除草薬；ベンチオカルブ、トリアラートなどのチオカルバマート除草薬；オキサジアゾンなどのオキサジアゾロン除草薬；イソオキサゾリドン除草薬、フェノキシ酢酸；フルアジホップ、アシフルオルフェン、ピフェノックス若しくはオキシフルオルフェンなどのジフェニルエーテル除草薬；トリフルラリンなどのジニトロアニリン除草薬；グルホシネート塩及びエステル並びにグリホサート塩及びエステルなどの有機ホスホン酸除草薬；並びに/又はプロモキシニル若しくはイオキシニルなどのジハロベンゾニトリル除草薬、安息香酸除草薬、パラコートなどのジピリジリウム除草薬；並びにクロマゾン、カルフェントラゾン、サフルフェナシル及びピロキサスルフォンなどの他の除草薬。

【0083】

特に好ましい除草薬は、2, 4 - ジクロロフェノキシ酢酸（2, 4 - D）、アトラジン、安息香酸としてのジカンバ、グリホサート、グルホシネート、イミダゾリノンとしてのイマザピック、クロロアセトアミドとしてのメトラクロール、ピクロラム、クロピラリド及びピリジンカルボン酸としてトリクロピル又は合成オーキシシ、それらのそれぞれの水に溶ける塩及びエステル並びにその混合物から選択され得る。

【0084】

殺虫薬は、すべての発生形態の昆虫に対して使用される駆除薬であり、昆虫の卵及び幼虫に対して使用される殺卵剤及び殺幼虫剤を含む。殺虫薬は、農業、医療、産業及び家庭で使用される。

【0085】

適した殺虫薬は、以下から選択されるものを含み得る：例えば、カンフェクロル、DDT、ヘキサクロロシクロヘキサン、ガンマヘキサクロロシクロヘキサン、メトキシクロール、ペンタクロロフェノール、TDE、アルドリン、クロルデン、クロルデコン、ジエルトリン、エンドスルファン、エンドリン、ヘプタクロル、マイレックス及びそれらの混合物などの塩素化殺虫薬；例えばアセファート、アジンホスメチル、ペンスリド、クロルエトキシホス、クロルピリホス、クロルピリホスメチル、ダイアジノン、ジクロルボス（DDVP）、ジクロトホス、ジメトアート、ジスルフォトン、エトプロブ、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアザート、マラチオン、メタアミドホス、メチダチオン、メチルパラチオン、メピンホス、ナレド、オメトエート、オキシデメトンメチル、パラチオン、ホラート、ホサロン、ホスメト、ホステブピリム、ピリミホスメチル、プロフェノホス、テルブホス、テトラクロルピンホス、トリブホス、トリクロルホン及びそれらの混合物などの有機リン化合物；例えばアルジカルブ、カルボフラン、カルバリル、メトミル、2 - (1 - メチルプロピル)フェニルメチルカルバマート及びそれらの混合物などのカルバマート；例えばアレトリン、ピフェントリン、デルタメトリン、ペルメトリン、レスメスリン、スミスリン、テトラメトリン、トラロメトリン、トランスフルトリ

ン及びそれらの混合物などのピレスロイド；例えばデリス（ロテノン）、ジョチュウギク、インドセンダン（アザジラクチン）、ニコチン、カフェイン及びそれらの混合物などの植物性毒素由来の化合物；イミダクロプリドなどのネオニコチノイド；アバメクチン、例えばエマメクチン；インドキサカルブなどのオキサジアジン；及びノ又はリナキシピルなどのアントラニリックジアミド。

【0086】

ダニ駆除剤は、ダニを死滅させる駆除薬である。抗生物質ダニ駆除剤、カルバマートダニ駆除剤、ホルムアミジンダニ駆除剤、ダニ成長調節物質、有機塩素、ペルメトリン及び有機リン酸ダニ駆除剤は、すべてこのカテゴリーに属している。軟体動物駆除剤は、軟体動物、例えばガ、ナメクジ及びカタツムリを防除するために使用される駆除薬である。これらの物質は、メタアルデヒド、メチオカルブ及び硫酸アルミニウムを含む。殺線虫薬は、寄生線虫（虫の一分）を死滅させるために使用される一種の化学的駆除薬である。

10

【0087】

最も好ましくは、本発明の農薬製剤又は種子コーティング組成物中に存在する活性物質は、トリアゾール殺真菌薬、ストロビルリン殺真菌薬又はその組み合わせから選択される。特にテブコナゾール、フルトリアホル、カルベンダジム、アゾキシストロピン、クレソキシムメチル、シプロコナゾール又はピラクロストロピンである。

【0088】

栄養素は、農薬活性物質に加えて又はそれに代わるものとして存在し得る。そのような製剤/組成物では、栄養素は、典型的には、乾燥形態である。

20

【0089】

栄養素は、好ましくは、固相栄養素であり得る。固体栄養素は、本発明では、融点が20を超え（標準圧力で）物質を意味することが理解されたい。固体栄養素は、不溶性栄養成分、すなわちかなりの固形分が添加後に濃縮物中に存在するような水中の溶解度である栄養成分も含むであろう。

【0090】

栄養素は、植物成長を促進又は改善することが所望されるか又はそうするのに必要である化学元素及び化合物を指す。適した栄養素は、一般に、多量栄養素又は微量栄養素として記載される。本発明による濃縮物中での使用のための適した栄養素は、すべての栄養化合物である。

30

【0091】

微量栄養素は、典型的には、微量金属又は微量元素を指し、より低い用量で適用されることが多い。適した微量栄養素は、亜鉛、ホウ素、塩素、銅、鉄、モリブデン及びマンガンから選択される微量元素を含む。微量栄養素は、可溶性の形態であり得るか又は不溶性の固体として含まれ得、塩であり得るか又はキレート化され得る。

【0092】

多量栄養素は、典型的には、窒素、リン及びカリウムを含むものを指し、硫酸アンモニウムなどの肥料及び水質調節剤を含む。適した多量栄養素は、肥料及び他の窒素、リン、カリウム、カルシウム、マグネシウム、硫黄含有化合物及び水質調節剤を含む。

【0093】

適した肥料は、窒素、リン、カリウム又は硫黄などの栄養素を提供する無機肥料を含む。肥料は、比較的低い濃度で希釈された製剤中において又はより濃縮された溶液として含まれ得、これは、非常に高いレベルで固体肥料及び溶液を含み得る。

40

【0094】

栄養素の包含は、特定の栄養素に依存し、微量栄養素は、典型的には、より低い濃度で含まれるが、多量栄養素は、典型的には、より高い濃度で含まれるであろうことが想定される。

【0095】

生物刺激構成要素は、農作物の成長を促進するために製剤又は種子コーティング組成物に添加され得る。生物刺激構成要素は、1つ以上の生物刺激剤を含み得るか又はそれから

50

なり得る。

【0096】

有用な生物刺激剤の例は、サイトカイニン、オーキシシン、ジベレリン、エチレン、アブジン酸などの植物成長ホルモン及び植物成長調節物質を含むが、これらに限定されない。他の生物刺激剤は、タンパク質加水分解物誘導体、海草抽出物、アミノ酸、植物エキス、キトサン誘導体、生体高分子、無機化合物、フミン質、微生物接種材料及び微生物生成物又はその混合物を含む。

【0097】

本発明の補助剤は、補助剤が含まれる農薬製剤に補助活性を提供し、且つ特に殺真菌薬補助活性を提供する適用を見出し得る。

10

【0098】

本明細書で使用されるように、用語「補助剤」又は「補助活性」は、農薬製剤に添加された場合、農芸化学的な所望の効果を改善するであろう化合物を指す。補助剤は、活性物質の性能の補助剤による改善により、希釈剤、混合物、活性物質又は標的に影響を及ぼし得る。補助剤は、駆除薬が機能するエリアに駆除薬を接着させるために、葉表面の表皮層を変化させて、駆除薬が入ることを可能にし、且つ/又は農薬製剤中の活性な駆除薬に対して標的有害生物を増感させるために使用され得る。

【0099】

特定の補助活性効果は、界面活性剤、乳化剤（分散剤及び懸濁化剤）、油、乳化性の油、混和剤、緩衝剤及び調節剤、消泡剤、付着剤、飛散抑制剤、シックナー、展着剤（湿潤薬）、固着剤（ビルダー及びエキステンダー）、植物浸透剤、輸送体、土壌浸透剤、安定化剤（UVフィルター）並びに/又は活性な駆除薬に対する有害生物増感を含み得る。

20

【0100】

好ましくは、本発明の補助剤は、タンクに添加して使用するために製剤化されるか、又は駆除薬濃縮物に直接製剤化される補助剤において、単独の構成要素又は主要な機能性剤として使用を見出し得る。

【0101】

灰色かび病菌（*B. cinerea*）に対する殺真菌薬のみ（例えば、ピラクロストロピンの）の活性に関する補助活性の基準として、阻害パーセント（殺真菌薬）で割った阻害パーセント（補助剤及び殺真菌薬）の値を定義することができ、より高い値が所望される。

30

【0102】

1の値は、そのため、殺真菌薬のみに対する補助剤/殺真菌薬の組み合わせの等しい活性を示すのに対して、1を超える値は、殺真菌薬のみよりも補助剤/殺真菌薬の組み合わせによる活性が高いことを示すであろう。

【0103】

本発明の活性物質は、1よりも大きい値を有し得る。好ましくは、1.2よりも大きく、最も好ましくは1.4よりも大きい。

【0104】

本明細書に記載される特徴のすべては、任意の組み合わせで上記の態様のいずれかと組み合わせられ得る。

40

【実施例】

【0105】

本発明をより容易に理解するために、ここで、例として以下の説明を参照する。

【0106】

列挙されるすべての試験及び物理的特性は、本明細書で他に述べられない限り又は参照した試験方法及び手法で他に述べられない限り、大気圧及び室温（すなわち20～25）で決定されたものであることが理解されるであろう。

【0107】

形成

50

シクロ(-Phe-Pip)ジケトピペラジン(I f)を合成するために、ピペコリン酸(201.7mg、1.5617mmol)及びフェニルアラニンメチルエステル(3.33g、15.4mmol)をジメチルホルムアミド(20mL)中で溶解し、氷浴中で0℃まで冷却し、その後、ベンゾトリアゾール-1-イルオキシトリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェイト(PyBOP、1.905g、3.661mmol)及びトリエチルアミン(0.5mL、3.587mmol)を添加した。反応溶液を室温まで温め、一晚撹拌した。

**【0108】**

反応液を真空中で濃縮し、粗生成物をもたらし、これを、CombiFlash(登録商標)NextGenシステム(Teledyne Isco)を使用して順相クロマトグラフィー(シリカ、ヘキサン 酢酸エチル)によって分画した。ジペプチド生成物(380.0mg、1.3087mmol、83.8%の収率)を含有する画分を組み合わせ、次のステップに進む前に真空中で蒸発させた。

10

**【0109】**

ジペプチドをメタノール(75mL)中で溶解し、その後、トリエチルアミン(1mL)を添加した。反応液を3日間、油浴中で60℃まで加熱し、その後、真空中で反応液を濃縮した。反応生成物を、CombiFlash(登録商標)NextGenシステム(Teledyne Isco)を使用して順相クロマトグラフィー(シリカ、ヘキサン 酢酸エチル)によって精製した。シクロ(-Phe-Pip)ジケトピペラジン生成物(75.5mg、0.2923mmol、22%の収率)を含有する画分を組み合わせ、真空中で蒸発させた。

20

**【0110】**

シクロ(-Phe-dhPro)ジケトピペラジン(I g)を合成するために、Boc-3,4-デヒドロ-L-プロリン(257.4mg、1.207mmol)、フェニルアラニンメチルエステル(390.4mg、1.810mmol)及びN-ヒドロキシスクシンイミド(205.0mg、1.781mmol)を無水CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>(10mL)中で溶解した。混合物を氷浴中で0℃まで冷却し、その後、ジイソプロピルカルボジイミド(0.273mL、1.763mmol)及びトリエチルアミン(0.245mL、1.758mmol)を添加した。

**【0111】**

反応液を室温まで温め、一晚撹拌し、その後、酢酸エチルと水との間で分配した。有機相を回収し、真空中で蒸発させ、粗生成物をもたらし、これを、CombiFlash(登録商標)NextGenシステム(Teledyne Isco)を使用して順相クロマトグラフィー(シリカ、ヘキサン 酢酸エチル)によって分画した。

30

**【0112】**

ジペプチド生成物(323.1mg、0.8629mmol、71%の収率)を含有する画分を組み合わせ、次のステップに進む前に真空中で蒸発させた。ジペプチドは、ジクロロメタン(6mL)中でジペプチドを溶解することによってBoc脱保護を受け、その後、トリフルオロ酢酸(6mL)を添加した。反応物を室温で一晩撹拌し、その後、真空中で反応液を濃縮した。

40

**【0113】**

粗生成物は、さらなる精製又は特徴付けなしで次のステップに使用した。脱保護されたジペプチドをメタノール(75mL)中で溶解し、その後、トリエチルアミン(1mL)を添加した。反応液を3日間、油浴中で60℃まで加熱し、その後、真空中で反応液を濃縮した。

**【0114】**

反応生成物を、CombiFlash(登録商標)NextGenシステム(Teledyne Isco)を使用して順相クロマトグラフィー(シリカ、ヘキサン 酢酸エチル)によって精製した。シクロ(-Phe-Pip)ジケトピペラジン生成物(65.2mg、0.2691mmol、31%の収率、2つのステップにわたる)を含有する画分

50

を組み合わせ、真空中で蒸発させた。

【0115】

ジケトピペラジンの構造は、質量分析及びNMR分析の組み合わせによって明らかにした。NMRスペクトルを、それぞれ $^1\text{H}$ 及び $^{13}\text{C}$ について400及び150MHzで動作するBruker Avance III 400MHz NMRスペクトロメーターに記録した。スペクトルは、残留溶媒のシグナルを基準とした。

【0116】

代謝物質のNMR分析は、文献データと一致し、構造をジケトピペラジン(Ia、Ib、Ic、Id、Ie、If及びIg)として確認した。

【0117】

補助活性パラメータ

パラメータ「阻害パーセント」及び「変化倍数」は、以下の通りに示され、計算されることが理解されるであろう。

【0118】

阻害パーセント - 阻害パーセントは、ビヒクル処理コントロールと比べた、22での48時間のインキュベーション後に微生物の目に見える成長を阻害する殺真菌薬及び/又は補助剤の量を示すことが理解されるであろう。これは、以下の式を使用して計算される。

$$[(O_C - O_T) / O_C] \times 100\%$$

ここで、

$O_C$  = ビヒクルを補足した寒天で成長したコロニーの直径(すなわちビヒクル処理コントロール)、及び

$O_T$  = 適切なビヒクル(すなわち水、 $\text{C}_2\text{H}_5\text{OH}$ 、 $\text{CH}_3\text{OH}$ 、 $\text{CH}_3\text{CN}$ 、DMSOなどの溶媒)中で製剤化した殺真菌薬及び/又は補助剤を補足した寒天で成長したコロニーの直径。

【0119】

変化倍数 - 変化倍数は、殺真菌薬のみと比較した微生物を阻害することにおける補助剤/殺真菌薬の組み合わせの尺度である。これは、補助剤が殺真菌薬のみと比べてどの程度性能を発揮するかを示す。これは、以下の式を使用して計算される。

$$I_{NHAF} / I_{NHF}$$

ここで、

$I_{NHAF}$  = 殺真菌薬及び補助剤により処置した場合の真菌成長の阻害パーセント、及び

$I_{NHF}$  = 殺真菌薬のみにより処置した場合の真菌成長の阻害パーセント。

【0120】

補助活性の結果

灰色かび病菌(*Botrytis cinerea*) (ATCC 90479)を日周UVサイクル(12時間UV光及び12時間暗)によって7日間、Difco Potato Dextrose Agar (PDA)で培養した。胞子を緩衝滅菌食塩水(w/v: 1% Tween (登録商標) 80を有する0.9% NaCl)中に収集し、血球計算器を使用してカウントした。胞子懸濁液は、標準化した種菌を作るために $8.5 \times 10^6$  40  
胞子/mLの最終濃度に調整した。

【0121】

補助剤を試験するための菌糸断片を調製するために、 $8.5 \times 10^4$ の胞子を150 x 25 mmチューブ中の10 mLのDifco Potato Dextrose Brothに接種するために使用した。チューブを48時間、220 RPM、22でインキュベートした。

【0122】

培養物から菌糸断片を作るために、培養物を、およそ20個の滅菌5 mm直径ガラスビーズを収容する50 mLプラスチック製コニカルチューブに移し、5分間ボルテックスした。ボルテックスした後、チューブを5分間立たせ、大きい菌糸体凝集物を沈殿させ、次 50

いで菌糸断片を含有する上部の層を取り出し、成長阻害アッセイのための種菌として使用した。

【0123】

殺真菌薬及び補助剤をメタノール中に溶解し、融解したPDAに添加し(約50)、次いで寒天を12ウェルのマルチウェルプレートのウェル中に分注した(1mL/ウェル)。プレートを室温まで冷却し、10 $\mu$ Lの菌糸種菌を各ウェルの中心に添加した。プレートを48時間22でインキュベートし、次いでコロニーの直径を、デジタルカリパスを使用して測定した。生物学的成長コントロールは、菌糸及びビヒクル(0.07%メタノール)からなり、ネガティブコントロールは、培地及びビヒクル(0.07%メタノール)であった。

10

【0124】

本発明の補助活性物質の結果を表1に示す。灰色かび病菌(*B. cinerea*)に対するピラクロストロピンによる補助活性は、試験した化合物のそれぞれについて観察され、最も顕著であったのは、0.06 $\mu$ g/mLでピラクロストロピンのみと比較して殺真菌活性で1.56倍及び1.52倍の増加を示したジケトピペラジンIe及びジケトピペラジンIcであった。

【0125】

ジケトピペラジン(Ia、Ib、Ic、Id、Ie、If及びIg)は、試験した濃度のいずれでも、そのみではいかなる特有の殺真菌活性も示さなかった。

【0126】

20

【表1】

表1.ピラクロストロピン(Pyra)の殺真菌活性に対する補助剤の効果。

補助剤	補助剤濃度 ( $\mu$ g/mL)	成長阻害における変化倍数	
		Pyra 0.0625 $\mu$ g/mL	Pyra 0.0313 $\mu$ g/mL
なし	0	1.00	1.00
DKP (Ia)	50	1.15	1.32
DKP (Ib)	50	1.45	1.14
DKP (Ic)	50	1.52	1.23
DKP (Id)	50	1.35	1.09
DKP (Ie)	50	1.56	0.96
DKP (If)	64	1.28	1.34
DKP (Ig)	64	1.27	1.22

30

【0127】

40

殺真菌活性に対する補助剤の効果は、成長阻害における増加倍数として示される。1の値は、殺真菌活性における増加を示さない。1未満の値は、殺真菌活性の低下を示し、1よりも大きい値は、殺真菌活性の増加を示す。

【0128】

表1では、補助剤は、明らかに様々な活性濃度で活性物質に補助活性特性を提供していることが分かる。

【0129】

本発明は、例として記載されているにすぎない上記の実施形態の詳細に限定されないことを理解されたい。多くの変更が、可能である。

50

## 【 国際調査報告 】

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No <b>PCT/IB2023/000148</b>
--

<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b>		
INV. <b>A01N43/60 A01N43/90 A01P3/00</b>		
ADD.		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
<b>B. FIELDS SEARCHED</b>		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) <b>A01N A01P</b>		
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) <b>EPO-Internal, CHEM ABS Data</b>		
<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
<b>X</b>	<b>WO 2008/007251 A2 (UNIV DEGLI STUDI UDINE [IT]; MUSETTI RITA [IT] ET AL.) 17 January 2008 (2008-01-17) the whole document</b> -----	<b>1-9</b>
<b>X</b>	<b>S. NISHANTH KUMAR ET AL: "Antifungal Activity of Diketopiperazines and Stilbenes Against Plant Pathogenic Fungi In Vitro", APPLIED BIOCHEMISTRY AND BIOTECHNOLOGY, vol. 172, no. 2, 12 October 2013 (2013-10-12), pages 741-754, XP055491294, New York ISSN: 0273-2289, DOI: 10.1007/s12010-013-0567-6 the whole document</b> ----- -/--	<b>1-9</b>
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents :		
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"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	
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date	"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	
"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)	"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	
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	"&" document member of the same patent family	
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed		
Date of the actual completion of the international search <b>26 June 2023</b>	Date of mailing of the international search report <b>06/07/2023</b>	
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Authorized officer <b>Bertrand, Franck</b>	

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

page 1 of 2

10

20

30

40

1

50

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No <b>PCT/IB2023/000148</b>
--

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	<p>WO 2013/002439 A1 (SNU R&amp;DB FOUNDATION [KR]; KANG SA-OUK [KR] ET AL.) 3 January 2013 (2013-01-03) the whole document</p> <p>-----</p>	1-9
X	<p>MAYA MITOVA ET AL: "Exocellular Peptides from Antarctic PsychrophilePseudoalteromonas Haloplanktis", MARINE BIOTECHNOLOGY, SPRINGER-VERLAG, NE, vol. 7, no. 5, 1 October 2005 (2005-10-01) , pages 523-531, XP019368156, ISSN: 1436-2236 the whole document</p> <p>-----</p>	1-6
X	<p>LONG, BIN: "Antibacterial metabolites from deep South China Sea-derived bacterium Bacillus amyloliquefaciens gas00,152", TIANRAN CHANWU YANJIU YU KAIFA, vol. 26, no. 6, 2014, pages 807-812, XP009544993, ISSN: 1001-6880 the whole document</p> <p>-----</p>	1-6

10

20

30

40

1

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

page 2 of 2

50

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International application No

**PCT/IB2023/000148**

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
<b>WO 2008007251</b>	<b>A2</b>	<b>17-01-2008</b>	
		<b>AU 2007273962 A1</b>	<b>17-01-2008</b>
		<b>CN 101484010 A</b>	<b>15-07-2009</b>
		<b>EP 2043442 A2</b>	<b>08-04-2009</b>
		<b>US 2009257984 A1</b>	<b>15-10-2009</b>
		<b>WO 2008007251 A2</b>	<b>17-01-2008</b>
		<b>ZA 200900304 B</b>	<b>24-02-2010</b>
-----			
<b>WO 2013002439</b>	<b>A1</b>	<b>03-01-2013</b>	<b>NONE</b>
-----			

10

20

30

40

50

## フロントページの続き

,MC,ME,MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,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,CV,CZ,DE,DJ,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IQ,IR,IS,IT,JM,JO,JP,KE,KG,KH,KN,KP,KR,KW,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,MG,MK,MN,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,WS,ZA,ZM,ZW

弁理士 青木 修二郎

(74)代理人 100217179

弁理士 村上 智史

(72)発明者 グレゴリー ジェームズ リントナー

アメリカ合衆国, ニュージャージー 08536, プレインズボロ, スカッターズ ミル ロード 777, ビルディング 2, スイート 200, シーノオー クローダ インコーポレイティド

(72)発明者 ブラッドリー アーノルド ハルトリ

カナダ国, プリンス エドワード アイランド シー1エー 4ピー3, シャーロットタウン, ユニバーシティ アベニュー 550, シーノオー クローダ カナダ リミティド

(72)発明者 ラッセル グレイグ カー

カナダ国, プリンス エドワード アイランド シー1エー 4ピー3, シャーロットタウン, ユニバーシティ アベニュー 550, シーノオー クローダ カナダ リミティド

(72)発明者 アリッサ ルイーズ グランウォルド

カナダ国, プリンス エドワード アイランド シー1エー 4ピー3, シャーロットタウン, ユニバーシティ アベニュー 550, シーノオー クローダ カナダ リミティド

(72)発明者 ヘベリン コレア ベランディア

カナダ国, プリンス エドワード アイランド シー1エー 4ピー3, シャーロットタウン, ユニバーシティ アベニュー 550, シーノオー クローダ カナダ リミティド

(72)発明者 ダグラス ヒューバート マーチバンク

カナダ国, プリンス エドワード アイランド シー1エー 4ピー3, シャーロットタウン, ユニバーシティ アベニュー 550, シーノオー クローダ カナダ リミティド

F ターム (参考) 4H011 AA01 BC09 DA15 DA16

4H061 AA01 DD07 DD18 EE29