(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2022年6月30日(30.06.2022)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2022/138017 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 413/04 (2006.01) *A01N 43/836* (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)

(21) 国際出願番号： PCT/JP2021/043858

(22) 国際出願日： 2021年11月30日(30.11.2021)

(25) 国際出願の言語： 日本語

(26) 国際公開の言語： 日本語

(30) 優先権データ：
特願 2020-212011 2020年12月22日(22.12.2020) JP

(71) 出願人: 日本農薬株式会社(**NIHON NOHYAKU CO., LTD.**) [JP/JP]; 〒1048386 東京都中央区京橋１丁目１９番８号 Tokyo (JP).

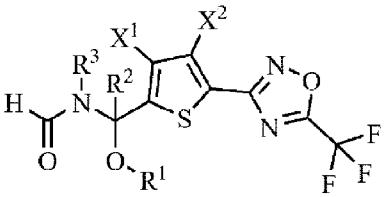
(72) 発明者: 藤田 直弥(**FUJITA Naoya**); 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町３４５ 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 岸上 隆介(**KISHIGAMI Ryusuke**); 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町３４５ 日本農薬株式会社総合研究所内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 特許業務法人浅村特許事務所 (**ASAMURA PATENT OFFICE, P.C.**); 〒1408776 東京都品川区東品川２丁目２番２４号 天王洲セントラルタワー Tokyo (JP).

(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): 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, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, IT, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, 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, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL,

(54) **Title:** OXADIAZOLE COMPOUND OR SALT THEREOF, AND AGRICULTURAL/HORTICULTURAL MICROBICIDE CONTAINING SAID COMPOUND, AND METHOD FOR USING SAME

(54) 発明の名称： オキサジアゾール化合物又はその塩類及び該化合物を含有する農園芸用殺菌剤並びにその使用方法



(I)

(57) **Abstract:** Damage caused by diseases is still significant in crop production such as in agriculture and horticulture. Thus, there has been a demand for the development of a novel agricultural/horticultural microbicide since there have been outbreaks of diseases resistant to existing chemicals. The present invention provides: an agricultural/horticultural microbicide containing, as an active ingredient, a compound represented by general formula (I) (in the formula, R^1 represents a hydrogen atom, a (C_1-C_6)alkyl group, or the like, R^2 represents a hydrogen atom or the like, R^3 represents a hydrogen atom, a (C_1-C_6)alkyl group, or the like, and X^1 and X^2 each represent a hydrogen atom, a halogen atom, or the like) or a salt thereof; and a method for using same.

(57) 要約：農業及び園芸等の作物生産において、病害による被害は今なお大きく、既存薬に対する抵抗性病害の発生等の要因から、新規な農園芸用殺菌剤の開発が望まれている。 本発明は、一般式（Ｉ） {式中、R^1は、水素原子又は（C_1－C_6）アルキル基等を示す。R^2は、水素原子等を示す。R^3は、水素原子又は（C_1－C_6）アルキル基等を示す。X^1及びX^2は、水素原子又はハロゲン原子等を示す。}で表される化合物又はその塩類を有効成分とする農園芸用殺菌剤並びにその使用方法を提供する。

WO 2022/138017 A1

［続葉有］

ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (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), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

一　国際調査報告（条約第21条(3)）

明　細　書

発明の名称 ：

オキサジアゾール化合物又はその塩類及び該化合物を含有する農園芸用殺菌剤並びにその使用方法

技術分野

[0001]　本発明は、オキサジアゾール化合物又はその塩類を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤及びその使用方法に関する。

背景技術

[0002]　特許文献１、２，３，４，５及び６に、ある種のオキサジアゾール誘導体が、植物病害の原因菌に対して殺菌活性を有することが記載されている。しかし、かかる文献中には、化合物の構造中に、ヘミアミナール構造を有する化合物については、開示も示唆もされていない。特許文献７には、ヘミアミナール構造を有するオキサゾール誘導体が、植物病害の原因菌に対して殺菌活性を有することが記載されているが、チオフェンにオキサジアゾール部位とヘミアミナール部位が結合した化合物については開示されていない。

先行技術文献

特許文献

[0003] 特許文献1：特開昭６３－１６２６８０号

特許文献2：国際公開第２０１５／１８５４８５号パンフレット

特許文献3：国際公開第２０１７／０５５４７３号パンフレット

特許文献4：国際公開第２０１８／１１８７８１号パンフレット

特許文献5：国際公開第２０１８／１５８３６５号パンフレット

特許文献6：国際公開第２０１８／１６２６４３号パンフレット

特許文献7：国際公開第２０１９／１３１８６７号パンフレット

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0004] 農業及び園芸等の作物生産において、病害による被害は今なお大きく、既存薬に対する抵抗性病害の発生等の要因から、新規な農園芸用殺菌剤の開発が望まれている。

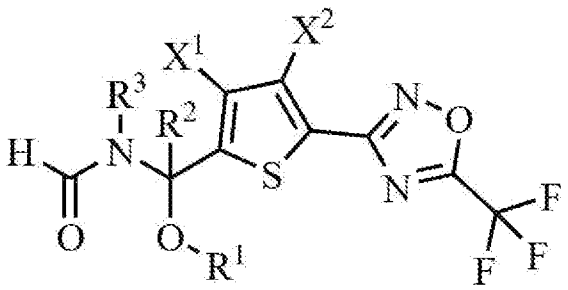
課題を解決するための手段

[0005] 本発明者等は新規な殺菌剤を開発すべく鋭意研究を重ねた結果、本発明の一般式（Ｉ）で表される化合物又はその塩類が、農園芸用殺菌剤として有用であることを見いだし、本発明を完成させた。

[0006] 即ち本発明は、

［１］一般式（Ｉ）

[化1]



(I)

{式中、Ｒ^{1}は、

(a1) 水素原子；

(a2) （Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキル基；

(a3) （Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$）アルケニル基；

(a4) （Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$）アルキニル基；

(a5) （Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$）シクロアルキル基；

(a6) ハロ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキル基；

(a7) ハロ（Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$）アルケニル基；

(a8) ハロ（Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$）アルキニル基；又は

(a9) ハロ（Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{8}$）シクロアルキル基を示す。

Ｒ^{2}は、

(b1) 水素原子；

(b2) （Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキル基；

(b3) （C_2－C_6）アルケニル基；

(b4) （C_2－C_6）アルキニル基；

(b5) （C_3－C_6）シクロアルキル基；

(b6) ハロ（C_1－C_6）アルキル基；

(b7) ハロ（C_2－C_6）アルケニル基；

(b8) ハロ（C_2－C_6）アルキニル基；又は

(b9) ハロ（C_3－C_8）シクロアルキル基を示す。

R^3は、

(c1) 水素原子；

(c2) （C_1－C_6）アルキル基；

(c3) （C_2－C_6）アルケニル基；

(c4) （C_2－C_6）アルキニル基；

(c5) （C_3－C_6）シクロアルキル基；

(c6) （C_1－C_6）アルキルカルボニル基；又は

(c7) （C_1－C_6）アルコキシカルボニル基を示す。

X^1及びX^2はそれぞれ独立に、

(e1) 水素原子；

(e2) ハロゲン原子；

(e3) シアノ基；

(e4) ニトロ基；

(e5) （C_1－C_6）アルキル基；

(e6) （C_3－C_6）シクロアルキル基；

(e7) （C_1－C_6）アルコキシ基；

(e8) ハロ（C_1－C_6）アルキル基；

(e9) ハロ（C_1－C_6）アルコキシ基；

(e10) ハロ（C_3－C_6）シクロアルキル基；

(e11) （C_1－C_6）アルキルチオ基；

(e12) （C_1－C_6）アルキルスルフィニル基;

(e13) （C_1－C_6）アルキルスルホニル基;

(e14) ハロ（C_1－C_6）アルキルチオ基；

(e15) ハロ（C_1－C_6）アルキルスルフィニル基;又は

(e16) ハロ（C_1－C_6）アルキルスルホニル基を示す。}

で表される化合物又はその塩類、

［２］R^1が、

(a2) （C_1－C_6）アルキル基；又は

(a5) （C_3－C_6）シクロアルキル基であり、

R^2が、

(b1) 水素原子であり、

R^3が、

(c1) 水素原子であり、

X^1及びX^2が、

(e1) 水素原子である、前記［１］に記載の化合物又はその塩類、

［３］R^1が、

(a2) （C_1－C_6）アルキル基である、前記［１］又は［２］に記載の化合物又はその塩類、

［４］前記［１］～［３］の何れかに記載の化合物又はその塩類を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺菌剤、

［５］前記［４］に記載の農園芸用殺菌剤の有効量を植物又は土壌に処理することを特徴とする植物病害の防除方法、

［６］前記［１］～［３］の何れかに記載の化合物又はその塩類の農園芸用殺菌剤としての使用、に関する。

発明の効果

[0007] 本発明の化合物又はその塩類は農園芸用殺菌剤として優れた効果を有する。

発明を実施するための形態

[0008] 本発明の化合物の一般式（Ｉ）の定義において、

「ハロ」とは、「ハロゲン原子」を意味し、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又はフッ素原子を示す。

[0009] 「（C_1－C_6）アルキル基」とは、例えば、メチル基、エチル基、ノルマルプロピル基、イソプロピル基、ノルマルブチル基、イソブチル基、セカンダリーブチル基、ターシャリーブチル基、ノルマルペンチル基、イソペンチル基、ターシャリーペンチル基、ネオペンチル基、２，３－ジメチルプロピル基、１－エチルプロピル基、１－メチルブチル基、２－メチルブチル基、ノルマルヘキシル基、イソヘキシル基、２－ヘキシル基、３－ヘキシル基、２－メチルペンチル基、３－メチルペンチル基、１，１，２－トリメチルプロピル基、３，３－ジメチルブチル基等の、直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数１～６個のアルキル基を示す。

[0010] 「（C_2－C_6）アルケニル基」とは、例えば、ビニル基、アリル基、イソプロペニル基、１－ブテニル基、２－ブテニル基、２－メチル－２－プロペニル基、１－メチル－２－プロペニル基、２－メチル－１－プロペニル基、ペンテニル基、１－ヘキセニル基、３，３－ジメチル－１－ブテニル基等の直鎖又は分鎖状の炭素原子数２～６個のアルケニル基を示し、「（C_2－C_6）アルキニル基」とは、例えばエチニル基、１－プロピニル基、２－プロピニル基、１－ブチニル基、２－ブチニル基、３－ブチニル基、３－メチル－１－プロピニル基、２－メチル－３－プロピニル基、ペンチニル基、１－ヘキシニル基、３－メチル－１－ブチニル基、３，３－ジメチル－１－ブチニル基等の、直鎖又は分鎖状の炭素原子数２～６個のアルキニル基を示す。

[0011] 「（C_3－C_6）シクロアルキル基」とは、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等の炭素原子数３～６個の環状のアルキル基を示し、「（C_1－C_6）アルコキシ基」としては、例えば、メトキシ基、エトキシ基、ノルマルプロポキシ基、イソプロポキシ基、ノルマルブトキシ基、セカンダリーブトキシ基、ターシャリーブトキシ基、ノルマルペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ターシャリーペンチルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、２，３－ジメチルプロピルオキシ基、１

－エチルプロピルオキシ基、１－メチルブチルオキシ基、ノルマルヘキシルオキシ基、イソヘキシルオキシ基、１，１，２－トリメチルプロピルオキシ基等の、直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数１～６個のアルコキシ基を示す。

[0012] 「（C_1－C_6）アルキルチオ基」とは、例えば、メチルチオ基、エチルチオ基、ノルマルプロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ノルマルブチルチオ基、セカンダリーブチルチオ基、ターシャリーブチルチオ基、ノルマルペンチルチオ基、イソペンチルチオ基、ターシャリーペンチルチオ基、ネオペンチルチオ基、２，３－ジメチルプロピルチオ基、１－エチルプロピルチオ基、１－メチルブチルチオ基、ノルマルヘキシルチオ基、イソヘキシルチオ基、１，１，２－トリメチルプロピルチオ基等の、直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数１～６個のアルキルチオ基を示す。

[0013] 「（C_1－C_6）アルキルスルフィニル基」とは、例えば、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、ノルマルプロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、ノルマルブチルスルフィニル基、セカンダリーブチルスルフィニル基、ターシャリーブチルスルフィニル基、ノルマルペンチルスルフィニル基、イソペンチルスルフィニル基、ターシャリーペンチルスルフィニル基、ネオペンチルスルフィニル基、２，３－ジメチルプロピルスルフィニル基、１－エチルプロピルスルフィニル基、１－メチルブチルスルフィニル基、ノルマルヘキシルスルフィニル基、イソヘキシルスルフィニル基、１，１，２－トリメチルプロピルスルフィニル基等の、直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数１～６個のアルキルスルフィニル基を示す。

[0014] 「（C_1－C_6）アルキルスルホニル基」とは、例えば、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、ノルマルプロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ノルマルブチルスルホニル基、セカンダリーブチルスルホニル基、ターシャリーブチルスルホニル基、ノルマルペンチルスルホニル基、イソペンチルスルホニル基、ターシャリーペンチルスルホニル基、ネオペンチルスルホニル基、２，３－ジメチルプロピルスルホニル基、１－エチルプロピルスルホニル基、１－メチルブチルスルホニル基、ノルマルヘキシルスルホ

ニル基、イソヘキシルスルホニル基、１，１，２－トリメチルプロピルスルホニル基等の、直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数１～６個のアルキルスルホニル基を示す。

[0015] 「（C_1－C_6）アルキルカルボニル基」とは、例えば、アセチル基、プロパノイル基、ブタノイル基、２－メチルプロパノイル基、ペンタノイル基、２－メチルブタノイル基、３－メチルブタノイル基、ピバロイル基、ヘキサノイル基、シクロプロピルカルボニル基等の前記（C_1－C_6）アルキル基を有するアルキルカルボニル基等の、炭素原子数２～７のアルキルカルボニル基を示す。

[0016] 「（C_1－C_6）アルコキシカルボニル基」とは、例えば、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、ノルマルプロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、ノルマルブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、セカンダリーブトキシカルボニル基、ターシャリーブトキシカルボニル基、ペンチルオキシカルボニル基等の前記（C_1－C_6）アルコキシ基を有するアルコキシカルボニル基等の、炭素原子数２～７のアルコキシカルボニル基を示す。

[0017] 上記「（C_1－C_6）アルキル基」、「（C_2－C_6）アルケニル基」、「（C_2－C_6）アルキニル基」、「（C_3－C_6）シクロアルキル基」、「（C_1－C_6）アルコキシ基」、「（C_1－C_6）アルキルチオ基」、「（C_1－C_6）アルキルスルフィニル基」又は「（C_1－C_6）アルキルスルホニル基」等の置換し得る位置に１又は２以上のハロゲン原子が置換されていても良く、置換されるハロゲン原子が２以上の場合は、ハロゲン原子は同一又は異なっても良い。それぞれ、「ハロ（C_1－C_6）アルキル基」、「ハロ（C_2－C_6）アルケニル基」、「ハロ（C_2－C_6）アルキニル基」、「ハロ（C_3－C_6）シクロアルキル基」、「ハロ（C_1－C_6）アルコキシ基」、「ハロ（C_1－C_6）アルキルチオ基」、「ハロ（C_1－C_6）アルキルスルフィニル基」又は「ハロ（C_1－C_6）アルキルスルホニル基」を示す。

[0018] 「（C_1－C_6）」、「（C_2－C_6）」、「（C_3－C_6）」等の表現は各種置

換基の炭素原子数の範囲を示す。更に、上記置換基が連結した基についても上記定義を示すことができ、例えば、「（C_1－C_6）アルコキシ（C_1－C_6）アルキル基」の場合は直鎖又は分岐鎖状の炭素数１～６個のアルコキシ基が直鎖又は分岐鎖状の炭素数１～６個のアルキル基に結合していることを示す。

[0019] 「アリール基」及び「アリール」とは、例えば、フェニル基、ナフチル基等の、炭素数６～１０個の芳香族炭化水素基を示す。

[0020] 「ヘテロアリール基」及び「ヘテロアリール」とは、例えば、フリル基、チエニル基、ピリジル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラジニル基、ピロリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、トリアジニル基等の、単環式芳香族複素環基等を示す。

[0021] 本発明の一般式(Ｉ)で表される化合物の塩類としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、燐酸塩等の無機酸塩類、酢酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、シュウ酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸塩等の有機酸塩類、ナトリウムイオン、カリウムイオン、カルシウムイオン、トリメチルアンモニウム等の無機又は有機の塩基との塩類を例示することができる。

[0022] 本発明の一般式(Ｉ)で表される化合物及びその塩類は、その構造式中に１つ又は複数個の不斉中心を有する場合があり、２種以上の光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあり、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、本発明の一般式(Ｉ)で表される化合物及びその塩類は、その構造式中に炭素－炭素二重結合に由来する２種の幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明は各々の幾何異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。

[0023] 本発明の一般式（Ｉ）で表される化合物において、以下に好ましい態様を

示す。

R^1として好ましくは、

(a2)（C_1－C_6）アルキル基；又は

(a5)（C_3－C_6）シクロアルキル基であり、

特に好ましくは、

(a2)（C_1－C_6）アルキル基である。

R^2として好ましくは、

(b1) 水素原子である。

R^3として好ましくは、

(c1) 水素原子である。

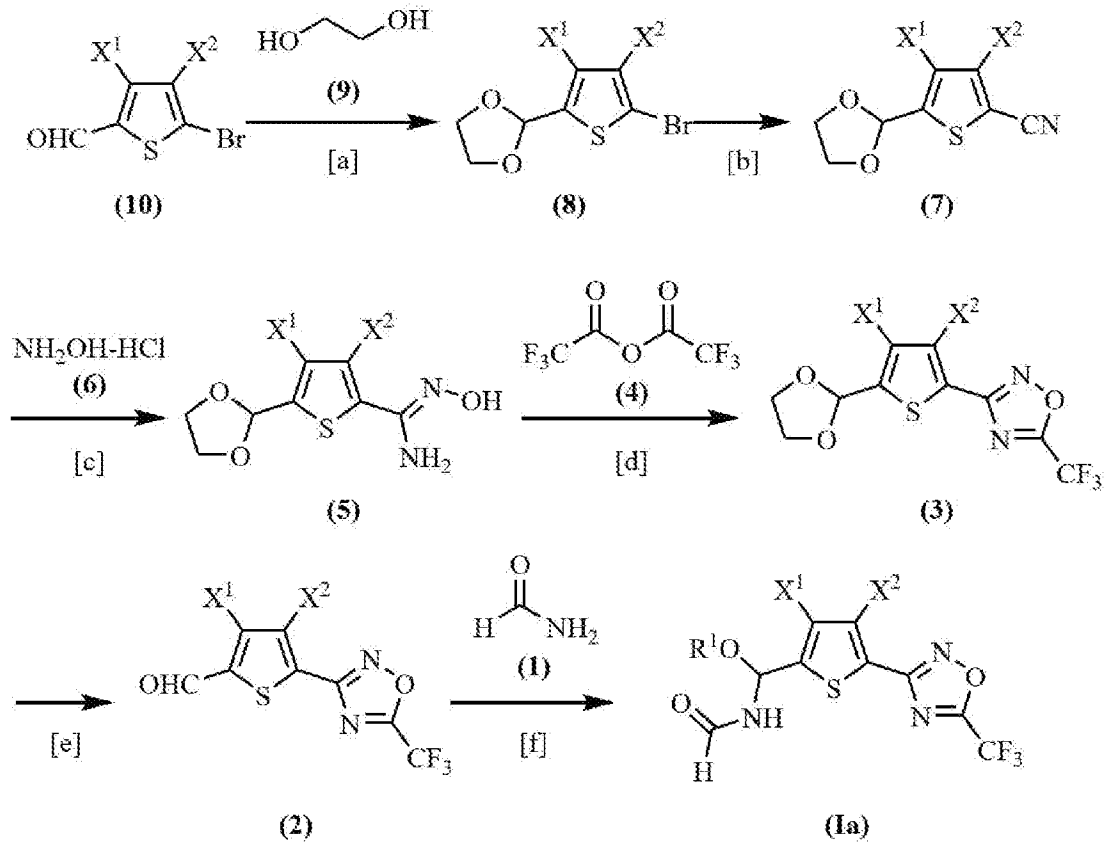
X^1及びX^2として好ましくは、

(e1) 水素原子である。

[0024] 本発明の各種化合物は、例えば下記製造方法によって製造することができるが、本発明の化合物の製造方法はこれらに限定されるものではない。

[0025] 製造方法１

[化2]



（式中、Ｒ^{1}、Ｘ^{1}及びＸ^{2}は前記と同じ意味を示す。）

[0026] 本発明の一般式（Ｉａ）で表される化合物は、下記工程［ａ］乃至［ｆ］によって製造することができる。

工程［ａ］ 一般式（１０）で表される化合物と、式（９）で表されるエチレングリコールとを反応させることにより、一般式（８）で表される化合物を製造する工程。

工程［ｂ］ 一般式（８）で表される化合物をシアノ化することにより、一般式（７）で表される化合物を製造する工程。

工程［ｃ］ 一般式（７）で表される化合物と、式（６）で表されるヒドロキシルアミン塩酸塩を反応させることにより、一般式（５）で表される化合物を製造する工程。

工程［ｄ］ 一般式（５）で表される化合物と、式（４）で表されるトリフ

ルオロ酢酸無水物とを反応させることにより、一般式（３）で表される化合物を製造する工程。

工程［ｅ］　一般式（３）で表される化合物を、脱保護することにより、一般式（２）で表される化合物を製造する工程。

工程［ｆ］　一般式（２）で表される化合物と、一般式（１）で表される化合物とを反応させることにより、本発明の一般式（Ｉａ）で表される化合物を製造する工程。

[0027] 工程［ａ］の製造方法

一般式（８）で表される化合物は、一般式（１０）で表される化合物を、酸触媒及び不活性溶媒存在下、式（９）で表されるエチレングリコールと反応させることにより、製造することができる。

[0028] 本反応で使用できる酸触媒としては、例えば、メチルスルホン酸、ｐ－トルエンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸等を挙げることができ、その使用量としては一般式（１０）で表される化合物に対して通常０．０１倍モル～５倍モルの範囲から適宜選択すれば良い。

[0029] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は２種以上混合して使用することができる。その使用量は、一般式（１０）で表される化合物１モルに対して通常０．１～１００Ｌの範囲から適宜選択すれば良い。

[0030] 本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は、通常室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、通常数分～４８時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に

応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0031] 工程［ｂ］の製造方法

一般式（７）で表される化合物は、一般式（８）で表される化合物を、不活性溶媒存在下、シアン化銅（Ｉ）と反応させることにより製造することができる。

[0032] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類；酢酸エチル、酢酸プロピル等のエステル類；アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；ジメチルスルホキシド、１，３－ジメチル－２－イミダゾリジノン等の非プロトン性極性溶媒等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は２種以上混合して使用することができる。その使用量は、一般式（８）で表される化合物１モルに対して通常０．１～１００Ｌの範囲から適宜選択すれば良い。

[0033] 本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は、通常室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、通常数分～４８時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0034] 工程［ｃ］の製造方法

一般式（５）で表される化合物は、一般式（７）で表される化合物を、塩基及び不活性溶媒存在下、式（６）で表されるヒドロキシルアミン塩酸塩と

反応させることにより製造することができる。

[0035] 本反応で使用できる塩基としては、例えば、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の水酸化物；ナトリウムメトキサイド、ナトリウムエトキサイド、ナトリウムターシャリーブトキサイド、カリウムターシャリーブトキサイド等のアルコキサイド；炭酸リチウム、炭酸水素リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸カルシウム、炭酸マグネシウム等の炭酸塩；酢酸リチウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩；ピリジン、ピコリン、ルチジン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられ、その使用量は一般式（７）で表される化合物に対して通常１倍モル～１０倍モルの範囲で使用される。

[0036] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類；ジメチルスルホキシド、１，３－ジメチル－２－イミダゾリジノン等の非プロトン性極性溶媒；メタノール、エタノール、２－プロパノール等のアルコール等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は２種以上混合して使用することができる。その使用量は、一般式（７）で表される化合物１モルに対して通常０．１～１００Ｌの範囲から適宜選択すれば良い。

[0037] 本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は、通常室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、通常数分～４８時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0038] 工程［ｄ］の製造方法

一般式（３）で表される化合物は、一般式（５）で表される化合物を、塩

基及び不活性溶媒存在下、式（４）で表されるトリフルオロ酢酸無水物と反応させることにより製造することができる。

[0039] 本反応で使用できる塩基としては、例えば、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の水酸化物；ナトリウムメトキサイド、ナトリウムエトキサイド、ナトリウムターシャリーブトキサイド、カリウムターシャリーブトキサイド等のアルコキサイド；炭酸リチウム、炭酸水素リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素カリウム、炭酸カルシウム、炭酸マグネシウム等の炭酸塩；酢酸リチウム、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等の酢酸塩；ピリジン、ピコリン、ルチジン、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等の有機塩基等が挙げられ、その使用量は一般式（５）で表される化合物に対して通常１倍モル～１０倍モルの範囲で使用される。

[0040] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類；酢酸エチル、酢酸プロピル等のエステル類；アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；ジメチルスルホキシド、１，３－ジメチル－２－イミダゾリジノン等の非プロトン性極性溶媒等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は２種以上混合して使用することができる。その使用量は、一般式（５）で表される化合物１モルに対して通常０．１～１００Ｌの範囲から適宜選択すれば良い。

[0041] 本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は、通常室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、通常数分～４８時間の範囲で行えば良い。反応終

了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0042] 工程［ｅ］の製造方法

一般式（２）であらわされる化合物は、一般式（３）で表される化合物のアセタール保護されたアルデヒド基を、有機化学で一般的に用いられる脱保護反応により脱保護することにより製造することができる。

工程［ｆ］の製造方法

本発明の一般式（Ｉａ）で表される化合物は、不活性溶媒存在下、一般式（２）で表される化合物と、式（１）で表されるホルムアミド及びチタン化合物とを反応させることにより製造することができる。

[0043] 本反応で使用することができるチタン化合物としては、例えば、チタン（ＩＶ）メトキシド、チタン（ＩＶ）エトキシド、チタン（ＩＶ）ｎ－プロポキシド、チタン（ＩＶ）ｉ－プロポキシド、チタン（ＩＶ）ｎ－ブトキシド、チタン（ＩＶ）ｔ－ブトキシド等を挙げることができ、その使用量としては一般式（２）で表される化合物に対して通常１倍モル～５倍モルの範囲から適宜選択すれば良い。

[0044] 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類；酢酸エチル、酢酸プロピル等のエステル類；アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；ジメチルスルホキシド、１，３－ジメチル－２－イミダゾリジノン等の非プロトン性極性溶媒等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は２種以上混合して使用することができる。その使用量は、一般式（２）で表される化合物１モ

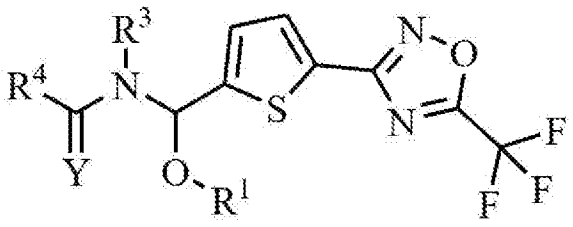
ルに対して通常０．１～１００Ｌの範囲から適宜選択すれば良い。

[0045] 本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。反応温度は、通常室温から使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、通常数分～４８時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応系から目的物を常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0046] 以下に本発明の一般式（Ｉ）で表される化合物の代表例を第1表に例示するが、本発明は、これらに限定されるものではない。

表中、「Ｍｅ」はメチル基を、「Ｅｔ」はエチル基を、「ｎ－Ｐｒ」はノルマルプロピル基を、「ｉ－Ｐｒ」はイソプロピル基を、「ｃ－Ｐｒ」はシクロプロピル基を、「ｎ－Ｂｕ」はノルマルブチル基を、「ｉ－Ｂｕ」はイソブチル基を、「ｓ－Ｂｕ」はセカンダリーブチル基を示す。物性は融点（℃）又は屈折率n_D（測定温度）を示す。

[0047] [化3]



(Ib)

[0048]

[表1]

第１表

化合物番号	R^2	R^3	R^4	Y	物性値
1-1	H	H	H	O	
1-2	Me	H	H	O	118-120
1-3	Et	H	H	O	122-124
1-4	*i*-Pr	H	H	O	101-102
1-5	*n*-Pr	H	H	O	
1-6	*c*-Pr	H	H	O	
1-7	*i*-Bu	H	H	O	106-107
1-8	*n*-Bu	H	H	O	
1-9	*s*-Bu	H	H	O	
1-10	*i*-Pr	H	Me	O	141-143

[0049] 本発明の一般式（Ｉ）で表される化合物又はその塩類を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤は穀類、果樹、野菜、その他の作物及び花卉類に発生する病害防除に適している。

[0050] 対象病害としては、糸状菌類病害、細菌類病害、ウイルス病病害等が挙げられる。糸状菌類病害としては、例えば、不完全菌類による病害（例えば、ボトリチス（Ｂｏｔｒｙｔｉｓ）属病害、ヘルミントスポリウム（Ｈｅｌｍｉｎｔｈｏｓｐｏｒｉｕｍ）属病害、フザリウム（Ｆｕｓａｒｉｕｍ）属病害、セプトリア（Ｓｅｐｔｏｒｉａ）属病害、サルコスポラ（Ｃｅｒｃｏｓｐｏｒａ）属病害、シュードサルコスポレラ（Ｐｓｅｕｄｏｃｅｒｃｏｓｐｏｒｅｌｌａ）属病害、リンコスポリウム（Ｒｈｙｎｃｈｏｓｐｏｒｉｕｍ）属病害、ピリキュラリア（Ｐｙｒｉｃｕｌａｒｉａ）属病害、アルタナリア（Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ）属病害等）；担子菌類による病害（例えば、ヘミレリア（Ｈｅｍｉｌｅｌｉａ）属病害、リゾクトニア（Ｒｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ）属病害、ウスティラゴ（Ｕｓｔｉｌａｇｏ）属病害、ティフラ（Ｔｙｐｈｕｌａ）属病害、プッキニア（Ｐｕｃｃｉｎｉａ）属病害等）；子のう菌類による病害（例えば、ベンチュリア（Ｖｅｎｔｕｒｉａ）属病害、ポ

ドスフェラ（Ｐｏｄｏｓｐｈａｅｒａ）属病害、レプトスファエリア（Ｌｅｐｔｏｓｐｈａｅｒｉａ）属病害、ブルメリア（Ｂｌｕｍｅｒｉａ）属病害、エリシフェ（Ｅｒｙｓｉｐｈｅ）属病害、ミクロドキュウム（Ｍｉｃｒｏｄｏｃｈｉｕｍ）属病害、スクレロチニア（Ｓｃｌｅｒｏｔｉｎｉａ）属病害、ゲウマノマイセス（Ｇａｅｕｍａｎｎｏｍｙｃｅｓ）属病害、モニリニア（Ｍｏｎｉｌｉｎｉａ）属病害、ウンシヌラ（Ｕｎｓｉｎｕｌａ）属病害等）；及びその他の菌類による病害（例えば、アスコクイタ（Ａｓｃｏｃｈｙｔａ）属病害、フォマ（Ｐｈｏｍａ）属病害、ピシウム（Ｐｙｔｈｉｕｍ）属病害、コルティシウム（Ｃｏｒｔｉｃｉｕｍ）属病害、ピレノフォラ（Ｐｙｒｅｎｏｐｈｏｒａ）属病害等）等が挙げられる。細菌類病害としては、例えば、シュードモナス（Ｐｓｅｕｄｏｍｏｎａｓ）属病害、ザントモナス（Ｘａｎｔｈｏｍｏｎａｓ）属病害、エルウィニア（Ｅｒｗｉｎｉａ）属病害等が挙げられる。ウイルス病病害としては、例えば、タバコモザイクウイルス（Ｔａｂａｃｃｏ　ｍｏｓａｉｃ　ｖｉｒｕｓ）等による病害等が挙げられる。

[0051] 糸状菌類病害の具体的病害としては、例えば、イネいもち病（Ｐｙｒｉｃｕｌａｒｉａ　ｏｒｙｚａｅ）、イネ紋枯病（Ｒｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ　ｓｏｌａｎｉ）、イネごま葉枯病（Ｃｏｃｈｉｏｂｏｌｕｓ　ｍｉｙａｂｅａｎｕｓ）、イネ苗立ち枯れ病（Ｒｈｉｚｏｐｕｓ　ｃｈｉｎｅｎｓｉｓ，Ｐｙｔｈｉｕｍ　ｇｒａｍｉｎｉｃｏｌａ，Ｆｕｓａｒｉｕｍ　ｇｒａｍｉｎｉｃｏｌａ，Ｆｕｓａｒｉｕｍ　ｒｏｓｅｕｍ，Ｍｕｃｏｒ　ｓｐ.，Ｐｈｏｍａ　ｓｐ.，Ｔｒｉｃｏｄｅｒｍａ　ｓｐ.）、イネ馬鹿苗病（Ｇｉｂｂｅｒｅｌｌａ　ｆｕｊｉｋｕｒｏｉ）、オオムギ及びコムギ等のうどんこ病（Ｂｌｕｍｅｒｉａ　ｇｒａｍｉｎｉｓ）、キュウリ等のうどんこ病（Ｓｐｈａｅｒｏｔｈｅｃａ　ｆｕｌｉｇｉｎｅａ）、ナス等のうどんこ病（Ｅｒｙｓｉｐｈｅ　ｃｉｃｈｏｒａｃｏａｒｕｍ）及び他の宿主植物のうどんこ病、オオムギ及びコムギ等の眼紋病（Ｐｓｅｕｄｏｃｅｒｃｏｓｐｏｒｅｌｌａ　ｈｅｒｐｏｔｒｉｃｈｏｉｄｅｓ）、コムギ等の黒穂病（Ｕｒｏｃｙｓ

ｔｉｓ ｔｒｉｔｉｃｉ）、オオムギ及びコムギ等の雪腐病（Ｍｉｃｒｏｄｏｃｈｉｕｍ ｎｉｖａｌｉｓ，Ｐｙｔｈｉｕｍ ｉｗａｙａｍａｉ，Ｔｙｐｈｌａ ｉｓｈｉｋａｒｉｅｎｓｉｓ，Ｔｙｐｈｌａ ｉｎｃａｒｎａｔａ，Ｓｃｌｅｒｏｔｉｎｉａ ｂｏｒｅａｌｉｓ）、オオムギ及びコムギ等の赤かび病（Ｆｕｓａｒｉｕｍ ｇｒａｍｉｎｅａｒｕｍ，Ｆｕｓａｒｉｕｍ ａｖｅｎａｃｅｕｍ，Ｆｕｓａｒｉｕｍ ｃｕｌｍｏｒｕｍ，Ｍｉｃｒｏｄｏｃｈｉｕｍ ｎｉｖａｌｉｓ）、オオムギ及びコムギ等のさび病（Ｐｕｃｃｉｎｉａ ｒｅｃｏｎｄｉｔａ，Ｐｕｃｃｉｎｉａ ｓｔｒｉｉｆｏｒｍｉｓ，Ｐｕｃｃｉｎｉａ ｇｒａｍｉｎｉｓ）、オオムギ及びコムギ等の立枯病（Ｇａｅｕｍａｎｎｏｍｙｃｅｓ ｇｒａｍｉｎｉｓ）、エンバクの冠さび病（Ｐｕｃｃｉｎｉａ ｃｏｒｏｎａｔａ）、及び他の植物のさび病、キュウリ及びイチゴ等の灰色かび病（Ｂｏｔｒｙｔｉｓ ｃｉｎｅｒｅａ）、トマト及びキャベツ等の菌核病（Ｓｃｌｅｒｏｔｉｎｉａ ｓｃｌｅｒｏｔｉｏｒｕｍ）、ジャガイモ及びトマト等の疫病（Ｐｈｙｔｏｐｈｔｈｏｒａ ｉｎｆｅｓｔａｎｓ）及び他の植物の疫病として、キュウリべと病（Ｐｓｅｕｄｏｐｅｒｏｎｏｓｐｏｒａ ｃｕｂｅｎｓｉｓ）、ブドウべと病（Ｐｌａｓｍｏｐａｒａ ｖｉｔｉｃｏｌａ）等の種々の植物のべと病、リンゴ黒星病（Ｖｅｎｔｕｒｉａ ｉｎａｅｑｕａｌｉｓ）、リンゴ斑点落葉病（Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ ｍａｌｉ）、ナシ黒斑病（Ａｌｔｅｒｎａｒｉａ ｋｉｋｕｃｈｉａｎａ）、カンキツ黒点病（Ｄｉａｐｏｒｔｈｅ ｃｉｔｒｉ）、カンキツそうか病（Ｅｌｓｉｎｏｅ ｆａｗｃｅｔｔｉ）、テンサイ褐斑病（Ｃｅｒｃｏｓｐｏｒａ ｂｅｔｉｃｏｌａ）、ラッカセイ褐斑病（Ｃｅｒｃｏｓｐｏｒａ ａｒａｃｈｉｄｉｃｏｌａ）、ラッカセイ黒渋病（Ｃｅｒｃｏｓｐｏｒａ ｐｅｒｓｏｎａｔａ）、コムギ葉枯れ病（Ｓｅｐｔｏｒｉａ ｔｒｉｔｉｃｉ）、コムギふ枯れ病（Ｌｅｐｔｏｓｐｈａｅｒｉａ ｎｏｄｏｒｕｍ）、オオムギ網斑病（Ｐｙｒｅｎｏｐｈｏｒａ ｔｅｒｅｓ）、オオムギ斑葉病（Ｐｙｒｅｎｏｐｈｏｒａ ｇｒａｍｉｎｅａ）、オオムギ雲形病（Ｒｈｙｎｃｈｏｓｐｏｒｉｕｍ ｓｅｃａｌｉｓ）

、コムギ裸黒穂病（Ｕｓｔｉｌａｇｏ　ｎｕｄａ）、コムギなまぐさ黒穂病（Ｔｉｌｌｅｔｉａ　ｃａｒｉｅｓ）、シバの葉腐病（Ｒｈｉｚｏｃｔｏｎｉａ　ｓｏｌａｎｉ）、シバのダラースポット病（Ｓｃｌｅｒｏｔｉｎｉａ　ｈｏｍｏｅｏｃａｒｐａ）等が挙げられる。

[0052] 細菌類病害の具体的病害としては、Ｐｓｅｕｄｏｍｏｎａｓ属による病害、例えば、キュウリ斑点細菌病（Ｐｓｅｕｄｏｍｏｎａｓ　ｓｙｒｉｎｇａｅ　ｐｖ．ｌａｃｈｒｙｍａｎｓ）、トマト青枯病（Ｐｓｅｕｄｏｍｏｎａｓ　ｓｏｌａｎａｃｅａｒｕｍ）及びイネ籾枯細菌病（Ｐｓｅｕｄｏｍｏｎａｓ　ｇｌｕｍａｅ）、Ｘａｎｔｈｏｍｏｎａｓ属による病害、例えば、キャベツ黒腐病（Ｘａｎｔｈｏｍｏｎａｓ　ｃａｍｐｅｓｔｒｉｓ）、イネ白葉枯病（Ｘａｎｔｈｏｍｏｎａｓ　ｏｒｙｚａｅ）及びカンキツかいよう病（Ｘａｎｔｈｏｍｏｎａｓ　ｃｉｔｒｉ）、Ｅｒｗｉｎｉａ属による病害、例えば、キャベツ軟腐病（Ｅｒｗｉｎｉａ　ｃａｒｏｔｏｖｏｒａ）等が挙げられる。

[0053] 本発明の一般式（Ｉ）で表される化合物又はその塩類を使用することができる有用植物は特に限定されるものではないが、例えば穀類（例えば、稲、大麦、小麦、ライ麦、オート麦、とうもろこし等）、豆類（大豆、小豆、そら豆、えんどう豆、いんげん豆、落花生等）、果樹・果実類（林檎、柑橘類、梨、葡萄、桃、梅、桜桃、胡桃、栗、アーモンド、バナナ等）、葉・果菜類（キャベツ、トマト、ほうれんそう、ブロッコリー、レタス、たまねぎ、ねぎ（あさつき、わけぎ）、ピーマン、なす、いちご、ペッパー、おくら、にら等）、根菜類（にんじん、馬鈴薯、さつまいも、さといも、だいこん、かぶ、れんこん、ごぼう、にんにく、らっきょう等）、加工用作物（棉、麻、ビート、ホップ、さとうきび、てんさい、オリーブ、ゴム、コーヒー、タバコ、茶等）、ウリ類（かぼちゃ、きゅうり、すいか、まくわうり、メロン等）、牧草類（オーチャードグラス、ソルガム、チモシー、クローバー、アルファルファ等）、芝類（高麗芝、ベントグラス等）、香料等鑑賞用作物（ラベンダー、ローズマリー、タイム、パセリ、胡椒、生姜等）、花卉類（き

く、ばら、カーネーション、蘭、チューリップ、ゆり等）、庭木（いちょう、さくら類、あおき等）、林木（トドマツ類、エゾマツ類、松類、ヒバ、杉、桧、ユウカリ等）等の植物を挙げることができる。

[0054] 上記「植物」には、イソキサフルトール等のＨＰＰＤ阻害剤、イマゼタピル、チフェンスルフロンメチル等のＡＬＳ阻害剤、グリホサート等のＥＰＳＰ合成酵素阻害剤、グルホシネート等のグルタミン合成酵素阻害剤、セトキシジム等のアセチルＣｏＡカルボキシラーゼ阻害剤、ブロモキシニル、ジカンバ、２，４－Ｄ等の除草剤に対する耐性を古典的な育種法、もしくは遺伝子組換え技術により耐性を付与された植物も含まれる。

[0055] 古典的な育種法により耐性を付与された「植物」の例としては、イマゼタピル等のイミダゾリノン系ＡＬＳ阻害型除草剤に耐性のナタネ、コムギ、ヒマワリ、イネがありＣｌｅａｒｆｉｅｌｄ（登録商標）の商品名で既に販売されている。同様に古典的な育種法によるチフェンスルフロンメチル等のスルホニルウレア系ＡＬＳ阻害型除草剤に耐性のダイズがあり、ＳＴＳダイズの商品名で既に販売されている。同様に古典的な育種法によりトリオンオキシム系、アリールオキシフェノキシプロピオン酸系除草剤などのアセチルＣｏＡカルボキシラーゼ阻害剤に耐性が付与された植物の例としてＳＲコーン等がある。

またアセチルＣｏＡカルボキシラーゼ阻害剤に耐性が付与された植物はプロシーディングズ・オブ・ザ・ナショナル・アカデミー・オブ・サイエンシーズ・オブ・ザ・ユナイテッド・ステーツ・オブ・アメリカ（Ｐｒｏｃ．Ｎａｔｌ．Ａｃａｄ．Ｓｃｉ．ＵＳＡ）８７巻、７１７５～７１７９頁（１９９０年）等に記載されている。またアセチルＣｏＡカルボキシラーゼ阻害剤に耐性の変異アセチルＣｏＡカルボキシラーゼがウィード・サイエンス（Ｗｅｅｄ Ｓｃｉｅｎｃｅ）５３巻、７２８～７４６頁（２００５年）等に報告されており、こうした変異アセチルＣｏＡカルボキシラーゼ遺伝子を遺伝子組換え技術により植物に導入するかもしくは抵抗性付与に関わる変異を植物アセチルＣｏＡカルボキシラーゼに導入する事により、アセチルＣｏＡカル

ボキシラーゼ阻害剤に耐性の植物を作出することができ、さらに、キメラプラスティ技術（Ｇｕｒａ Ｔ．１９９９．Ｒｅｐａｉｒｉｎｇ ｔｈｅ Ｇｅｎｏｍｅ’ｓ Ｓｐｅｌｌｉｎｇ Ｍｉｓｔａｋｅｓ．Ｓｃｉｅｎｃｅ ２８５：３１６－３１８．）に代表される塩基置換変異導入核酸を植物細胞内に導入して植物のアセチルＣｏＡカルボキシラーゼ遺伝子やＡＬＳ遺伝子等に部位特異的アミノ酸置換変異を導入することにより、アセチルＣｏＡカルボキシラーゼ阻害剤やＡＬＳ阻害剤等に耐性の植物を作出することができ、これらの植物に対しても本発明の一般式（１）で表される化合物又はその塩類を使用することができる。

[0056] 更に遺伝子組換え植物で発現される毒素として、バチルス・セレウスやバチルス・ポピリエ由来の殺虫性タンパク；バチルス・チューリンゲンシス由来のＣｒｙ１Ａｂ、Ｃｒｙ１Ａｃ、Ｃｒｙ１Ｆ、Ｃｒｙ１Ｆａ２、Ｃｒｙ２Ａｂ、Ｃｒｙ３Ａ、Ｃｒｙ３Ｂｂ１またはＣｒｙ９Ｃ等のδ－エンドトキシン；ＶＩＰ１、ＶＩＰ２、ＶＩＰ３またはＶＩＰ３Ａ等の殺虫タンパク；線虫由来の殺虫タンパク；さそり毒素、クモ毒素、ハチ毒素または昆虫特異的神経毒素等動物によって産生される毒素；糸状菌類毒素；植物レクチン；アグルチニン；トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パパイン阻害剤等のプロテアーゼ阻害剤；リシン、トウモロコシ－ＲＩＰ、アブリン、ルフィン、サポリン、ブリオジン等のリボゾーム不活性化タンパク（ＲＩＰ）；３－ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド－ＵＤＰ－グルコシルトランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ等のステロイド代謝酵素；エクダイソン阻害剤；ＨＭＧ－ＣｏＡリダクターゼ；ナトリウムチャネル、カルシウムチャネル阻害剤等のイオンチャネル阻害剤；幼若ホルモンエステラーゼ；利尿ホルモン受容体；スチルベンシンターゼ；ビベンジルシンターゼ；キチナーゼ；グルカナーゼ等が挙げられる。

[0057] またこの様な遺伝子組換え植物で発現される毒素として、Ｃｒｙ１Ａｂ、Ｃｒｙ１Ａｃ、Ｃｒｙ１Ｆ、Ｃｒｙ１Ｆａ２、Ｃｒｙ２Ａｂ、Ｃｒｙ３Ａ、

Ｃｒｙ３Ｂｂ１、Ｃｒｙ９Ｃ、Ｃｒｙ３４ＡｂまたはＣｒｙ３５Ａｂ等のδ－エンドトキシンタンパク；ＶＩＰ１、ＶＩＰ２、ＶＩＰ３またはＶＩＰ３Ａ等の殺虫タンパクのハイブリッド毒素；一部を欠損した毒素；修飾された毒素も含まれる。ハイブリッド毒素は組換え技術を用いて、これらタンパクの異なるドメインの新しい組み合わせによって作り出される。一部を欠損した毒素としては、アミノ酸配列の一部を欠損したＣｒｙ１Ａｂが知られている。修飾された毒素としては、天然型の毒素のアミノ酸の１つまたは複数が置換されている。

[0058] これら毒素の例及びこれら毒素を合成する事ができる組換え植物は、ＥＰ－Ａ－０３７４７５３、ＷＯ９３／０７２７８、ＷＯ９５／３４６５６、ＥＰ－Ａ－０４２７５２９、ＥＰ－Ａ－４５１８７８、ＷＯ０３／０５２０７３等に記載されている。

[0059] 本発明の農園芸用殺菌剤はそれらの技術と併用、あるいは体系化して用いることもできる。

[0060] 本発明の農園芸用殺菌剤は各種病害を防除するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で病害防除に有効な量を当該病害の発生が予測される植物に使用すればよく、例えば果樹、穀類、野菜等において発生する病害に対しては茎葉部に散布する他に、種子の薬剤への浸漬、種子粉衣、カルパー処理等の種子処理、土壌全層混和、作条施用、床土混和、セル苗処理、植え穴処理、株元処理、トップドレス、イネの箱処理、水面施用等、土壌等に処理して根から吸収させて使用することもできる。加えて、養液（水耕）栽培における養液への施用、くん煙あるいは樹幹注入等による使用もできる。

[0061] 更に、本発明の農園芸用殺菌剤は、そのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で病害防除に有効な量を当該病害の発生が予測される場所に使用すればよい。

[0062] 種子処理の方法としては、例えば、液状又は固体状の製剤を希釈又は希釈せずして液体状態にて種子を浸漬して薬剤を浸透させる方法、固形製剤又は

液状製剤を種子と混和、粉衣処理して種子の表面に付着させる方法、樹脂、ポリマー等の付着性の担体と混和して種子にコーティングする方法、植え付けと同時に種子付近に散布する方法等が挙げられる。

当該種子処理を行う「種子」とは、植物の繁殖に用いられる栽培初期の植物体を意味し、例えば、種子の他、球根、塊茎、種芋、株芽、むかご、鱗茎、あるいは挿し木栽培用の栄養繁殖用の植物体を挙げることができる。

[0063] 本発明の使用方法を実施する場合の植物の「土壌」又は「栽培担体」とは、作物を栽培するための支持体、特に根を生えさせる支持体を示すものであり、材質は特に制限されないが、植物が生育しうる材質であれば良く、いわゆる土壌、育苗マット、水等であっても良く、具体的な素材としては例えば、砂、軽石、バーミキュライト、珪藻土、寒天、ゲル状物質、高分子物質、ロックウール、グラスウール、木材チップ、バーク等であっても良い。

[0064] 作物茎葉部等への散布方法としては、乳剤、フロアブル剤等の液体製剤又は水和剤もしくは顆粒水和剤等の固形製剤を水で適宜希釈し、散布する方法、粉剤を散布する方法、又はくん煙等が挙げられる。

[0065] 土壌への施用方法としては、例えば、液体製剤を水に希釈又は希釈せずして植物体の株元または育苗用苗床等に施用する方法、粒剤を植物体の株元又は育苗のための苗床等に散布する方法、播種前または移植前に粉剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤等を散布し土壌全体と混和する方法、播種前または植物体を植える前に植え穴、作条等に粉剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤等を散布する方法等が挙げられる。

[0066] 水稲の育苗箱への施用方法としては、剤型は、例えば播種時施用、緑化期施用、移植時施用などの施用時期により異なる場合もあるが、粉剤、顆粒水和剤、粒剤等の剤型で施用すればよい。培土との混和によっても施用することができ、培土と粉剤、顆粒水和剤又は粒剤等との混和、例えば、床土混和、覆土混和、培土全体への混和等することができる。単に、培土と各種製剤を交互に層状にして施用してもよい。

[0067] 水田への施用方法としては、ジャンボ剤、パック剤、粒剤、顆粒水和剤等

の固形製剤、フロアブル、乳剤等の液体状製剤を、通常は、湛水状態の水田に散布する。その他、田植え時には、適当な製剤をそのまま、あるいは、肥料に混和して土壌に散布、注入することもできる。また、水口や灌漑装置等の水田への水の流入元に乳剤、フロアブル等の薬液を利用することにより、水の供給に伴い省力的に施用することもできる。

[0068] 畑作物においては、播種から育苗期において、種子又は植物体に近接する栽培担体等へ処理ができる。畑に直接播種する植物においては、種子への直接処理の他、栽培中の植物の株元への処理が好適である。粒剤を用いて散布処理又は水に希釈あるいは希釈しない薬剤を液状にて潅注処理を行うこと等ができる。粒剤を播種前の栽培担体と混和させた後、播種するのも好ましい処理である。

[0069] 移植を行う栽培植物の播種、育苗期の処理としては、種子への直接処理の他、育苗用苗床への、液状とした薬剤の潅注処理又は粒剤の散布処理が好ましい。また、定植時に粒剤を植え穴に処理をしたり、移植場所近辺の栽培担体に混和することも好ましい処理である。

[0070] 本発明の一般式（Ｉ）で表される化合物又はその塩類は、農薬製剤上の常法に従い使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。

[0071] 即ち、本発明の一般式(Ｉ)で表される化合物又はその塩類はこれらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させて適宜の剤型、例えば懸濁剤（フロアブル剤）、乳剤、油剤、液剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、パック剤、ジャンボ剤、サスポエマルジョン等に製剤して使用すれば良い。

[0072] 本発明の農園芸用殺菌剤は、有効成分の他に必要に応じて農薬製剤に通常用いられる添加成分を含有することができる。この添加成分としては、固体担体、液体担体等の担体、界面活性剤、分散剤、湿潤剤、結合剤、粘着付与剤、増粘剤、着色剤、拡展剤、展着剤、凍結防止剤、固結防止剤、崩壊剤、分解防止剤等が挙げられる。その他必要に応じ、防腐剤、植物片等を添加成

分に用いてもよい。これらの添加成分は単独で用いてもよいし、また、２種以上を組み合わせて用いてもよい。

[0073] 固体担体としては、例えば石英、クレー、カオリナイト、ピロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライト、珪藻土等の天然鉱物類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウム、塩化カリウム等の無機塩類、合成ケイ酸、合成ケイ酸塩、デンプン、セルロース、植物粉末（例えばおがくず、ヤシガラ、トウモロコシ穂軸、タバコ茎等）等の有機固体担体、ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン等のプラスチック担体、尿素、無機中空体、プラスチック中空体、フュームド シリカ（fumed silica，ホワイトカーボン）等が挙げられる。これらは単独で用いてもよいし、また、２種以上を組み合わせて用いてもよい。

[0074] 液体担体としては、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール等の一価アルコール類や、エチレングリコール、ジエチレングリコール、プロピレングリコール、ヘキシレングリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、グリセリン等の多価アルコール類のようなアルコール類、プロピレングリコールエーテル等の多価アルコール化合物類、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等のケトン類、エチルエーテル、ジオキサン、エチレングリコールモノエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ＴＨＦ等のエーテル類、ノルマルパラフィン、ナフテン、イソパラフィン、ケロシン、鉱油等の脂肪族炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、ジイソプロピルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート、アジピン酸ジメチル等のエステル類、γ-ブチロラクトン等のラクトン類、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、Ｎ-アルキルピロリジノン等のアミド類、アセトニトリル等のニトリル類、

ジメチルスルホキシド等の硫黄化合物類、大豆油、ナタネ油、綿実油、ヒマシ油等の植物油、水等を挙げることができる。これらは単独で用いてもよいし、また、２種以上を組み合わせて用いてもよい。

[0075] 分散剤や湿展剤として用いる界面活性剤としては、例えばソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ショ糖脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪酸ジエステル、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンジアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテルホルマリン縮合物、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリスチレンポリオキシエチレンブロックポリマー、アルキルポリオキシエチレンポリプロピレンブロックコポリマーエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアミン、ポリオキシエチレン脂肪酸アミド、ポリオキシエチレン脂肪酸ビスフェニルエーテル、ポリアルキレンベンジルフェニルエーテル、ポリオキシアルキレンスチリルフェニルエーテル、アセチレンジオール、ポリオキシアルキレン付加アセチレンジオール、ポリオキシエチレンエーテル型シリコーン、エステル型シリコーン、フッ素系界面活性剤、ポリオキシエチレンひまし油、ポリオキシエチレン硬化ひまし油等の非イオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、脂肪酸塩、ポリカルボン酸塩、ポリアクリル酸塩、Ｎ-メチル-脂肪酸サルコシネート、樹脂酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテルリン酸塩等のアニオン性界面

活性剤、ラウリルアミン塩酸塩、ステアリルアミン塩酸塩、オレイルアミン塩酸塩、ステアリルアミン酢酸塩、ステアリルアミノプロピルアミン酢酸塩、アルキルトリメチルアンモニウムクロライド、アルキルジメチルベンザルコニウムクロライド等のアルキルアミン塩等のカチオン界面活性剤、アミノ酸型又はベタイン型等の両性界面活性剤等が挙げられる。これらの界面活性剤は単独で用いてもよいし、また、２種以上を組み合わせて用いてもよい。

[0076] 結合剤や粘着付与剤としては、例えばカルボキシメチルセルロースやその塩、デキストリン、水溶性デンプン、キサンタンガム、グアーガム、蔗糖、ポリビニルピロリドン、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、ポリビニルアセテート、ポリアクリル酸ナトリウム、平均分子量６０００～２００００のポリエチレングリコール、平均分子量１０万～５００万のポリエチレンオキサイド、燐脂質（例えばセファリン、レシチン等）セルロース粉末、デキストリン、加工デンプン、ポリアミノカルボン酸キレート化合物、架橋ポリビニルピロリドン、マレイン酸とスチレン類の共重合体、（メタ）アクリル酸系共重合体、多価アルコールからなるポリマーとジカルボン酸無水物とのハーフエステル、ポリスチレンスルホン酸の水溶性塩、パラフィン、テルペン、ポリアミド樹脂、ポリアクリル酸塩、ポリオキシエチレン、ワックス、ポリビニルアルキルエーテル、アルキルフェノールホルマリン縮合物、合成樹脂エマルション等が挙げられる。

[0077] 増粘剤としては、例えばキサンタンガム、グアーガム、ダイユウタンガム、カルボキシメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、カルボキシビニルポリマー、アクリル系ポリマー、デンプン化合物、多糖類のような水溶性高分子、高純度ベントナイト、フュームド シリカ(fumed silica, ホワイトカーボン)のような無機微粉等が挙げられる。

[0078] 着色剤としては、例えば酸化鉄、酸化チタン、プルシアンブルーのような無機顔料、アリザリン染料、アゾ染料、金属フタロシアニン染料のような有機染料等が挙げられる。

[0079] 凍結防止剤としては、例えば、エチレングリコール、ジエチレングリコー

ル、プロピレングリコール、グリセリン等の多価アルコール類等が挙げられる。

[0080] 固結防止や崩壊促進のための補助剤としては、例えばデンプン、アルギン酸、マンノース、ガラクトース等の多糖類、ポリビニルピロリドン、フュームド シリカ(fumed silica, ホワイトカーボン)、エステルガム、石油樹脂、トリポリリン酸ナトリウム、ヘキサメタリン酸ナトリウム、ステアリン酸金属塩、セルロース粉末、デキストリン、メタクリル酸エステルの共重合体、ポリビニルピロリドン、ポリアミノカルボン酸キレート化合物、スルホン化スチレン・イソブチレン・無水マレイン酸共重合体、デンプン・ポリアクリロニトリルグラフト共重合体等が挙げられる。

[0081] 分解防止剤としては、例えばゼオライト、生石灰、酸化マグネシウムのような乾燥剤、フェノール化合物、アミン化合物、硫黄化合物、リン酸化合物等の酸化防止剤、サリチル酸化合物、ベンゾフェノン化合物等の紫外線吸収剤等が挙げられる。

[0082] 防腐剤としては、例えばソルビン酸カリウム、１，２-ベンゾチアゾリン-３-オン等が挙げられる。

[0083] 更に必要に応じて機能性展着剤、ピペロニルブトキサイド等の代謝分解阻害剤等の活性増強剤、プロピレングリコール等の凍結防止剤、ＢＨＴ等の酸化防止剤、紫外線吸収剤等その他の補助剤も使用することができる。

[0084] 有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、本発明の農園芸用殺菌剤１００重量部中、０．０１～９０重量部の範囲から適宜選択して使用すれば良く、例えば、粉剤、粒剤、乳剤又は水和剤とする場合は０．０１～５０重量部（農園芸用殺菌剤全体の重量に対して０．０１～５０重量％）が適当である。

[0085] 本発明の一般式（Ｉ）で表される化合物又はその塩類の使用量は種々の因子、例えば目的、対象病害、作物の生育状況、病害の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として１０アール当たり０．００１ｇ～１０ｋｇ、好ましくは０．０

１ｇ～１ｋｇの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

[0086] 本発明の一般式（Ｉ）で表される化合物又はその塩類を活性成分として含む農園芸用殺菌剤の使用に際しては、適当な濃度に希釈して散布するか又はそのまま施用する。

[0087] 本発明の農園芸用殺菌剤は、防除対象病害、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、生物農薬等と混合して使用することも可能であり、また、使用場面に応じて除草剤、植物成長調節剤、肥料等と混合して使用することも可能である。以下に代表的な化合物を例示するが、これらに限定されるものではない。

[0088] かかる目的で使用する他の農園芸用殺菌剤として例えば、アウレオフンギン（aureofungin）、アザコナゾール（azaconazole）、アジチラム（azithiram）、アシペタックス（acypetacs）、アシベンゾラル（acibenzolar）、アシベンゾラルＳメチル(acibenzolar-S-methyl）、アゾキシストロビン（azoxystrobin）、アニラジン（anilazine）、アミスルブロム（amisulbrom）、アムプロピルホス（ampropylfos）、アメトクトラジン（ametoctradin）、アリルアルコール（allyl alcohol）、アルジモルフ（aldimorph）、アンバム(amobam）、イソチアニル（isotianil）、イソバレジオン（isovaledione）、イソピラザム（isopyrazam）、イソフェタミド(isofetamid)、イソプロチオラン（isoprothiolane）、イプコナゾール（ipconazole）、イプロジオン（iprodione）、イプロバリカルブ（iprovalicarb）、イプロベンホス（iprobenfos）、イマザリル（imazalil）、イミノクタジン（iminoctadine）、イミノクタジンアルベシル酸塩(iminoctadine-albesilate）、イミノクタジン酢酸塩(iminoctadine-triacetate）、イミベンコナゾール（imibenconazole）、ウニコナゾール（uniconazole）、ウニコナゾールＰ（uniconazole-P）、エクロメゾール(echlomezole）、エジフェンホス(edifenphos）、エタコナゾール（etaconazole）、エタボキサム（ethaboxam）、エチリモール（ethirimol）、エテム（etem）、エトキシキン（ethoxyquin）、エトリジアゾール(etridiaz

ole）、エネストロブリン（enestroburin）、エノキサストロビン(enoxastrobin)、エポキシコナゾール（epoxiconazole）、オキサジキシル（oxadixyl）、オキサチアピプロリン(oxathiapiprolin)、オキシカルボキシン（oxycarboxin）、オキシキノリン銅（copper-8-quinolinolate）、オキシテトラサイクリン（oxytetracycline）、オキシン銅(copper-oxinate）、オキスポコナゾール(oxpoconazole）、オキスポコナゾールフマル酸塩(oxpoconazole-fumarate）、オキソリニック酸（oxolinic acid）、オクチリノン（octhilinone）、オフラセ（ofurace）、オリサストロビン（orysastrobin）、カーバム(metam-sodium）等の土壌殺菌剤、カスガマイシン（kasugamycin）、カルバモルフ（carbamorph）、カルプロパミド（carpropamid）、カルベンダジム（carbendazim）、カルボキシン（carboxin）、カルボン（carvone）、キナザミド（quinazamid）、キナセトール（quinacetol）、キノキシフェン（quinoxyfen）、キノメチオネート（chinomethionat）、キノメチオネート(quinomethionate）、キャプタホール（captafol）、キャプタン（captan）、キララキシル（kiralaxyl）、キンコナゾール（quinconazole）、キントゼン（quintozene）、グアザチン（guazatine）、クフラネブ（cufraneb）、クプロバム（cuprobam）、クモキシストロビン(coumoxystrobin)、グリオジン（glyodin）、グリセオフルビン（griseofulvin）、クリムバゾール（climbazole）、クレゾール（cresol）、クレソキシムメチル(kresoxim-methyl）、クロゾリネート（chlozolinate）、クロトリマゾール（clotrimazole）、クロベンチアゾン（chlobenthiazone）、クロラニホルメタン（chloraniformethan）、クロラニル（chloranil）、クロルキノックス（chlorquinox）、クロルピクリン（chloropicrin）、クロルフェナゾール（chlorfenazole）、クロロジニトロナフタレン（chlorodinitronaphthalene）、クロロタロニル（chlorothalonil）、クロロネブ（chloroneb）、サリチルアニリド（salicylanilide）、ザリラミド（zarilamid）、シアゾファミド（cyazofamid）、ジエチルピロパカーボナート（diethyl pyrocarbonate）、ジエトフェンカルブ（diethofencarb）、シクラフラミド（cyclafuramid）、シクロシメット（diclocymet）、ジ

クロゾリン（dichlozoline）、ジクロブトラゾール（diclobutrazol）、ジクロフルアニド(dichlofluanid)、シクロヘキシミド（cycloheximide）、ジクロメジン（diclomezine）、ジクロラン（dicloran）、ジクロロフェン（dichlorophen）、ジクロン（dichlone）、ジスルフィラム（disulfiram）、ジタリムフォス（ditalimfos）、ジチアノン（dithianon）、ジニコナゾール（diniconazole）、ジニコナゾールM（diniconazole-M）、ジネブ（zineb）、ジノカップ（dinocap）、ジノクトン（dinocton）、ジノスルホン（dinosulfon）、ジノテルボン（dinoterbon）、ジノブトン（dinobuton）、ジノペントン（dinopenton）、ジピメチトロン(dipymetitrone)、ジピリチオン（dipyrithione）、ジフェニルアミン（diphenylamine）、ジフェノコナゾール（difenoconazole）、シフルフェナミド（cyflufenamid）、ジフルメトリム(diflumetorim)、シプロコナゾール（cyproconazole）、シプロジニル（cyprodinil）、シプロフラム（cyprofuram）、シペンダゾール（cypendazole）、シメコナゾール（simeconazole）、ジメチリモール（dimethirimol）、ジメトモルフ（dimethomorph）、シモキサニル（cymoxanil）、ジモキシストロビン（dimoxystrobin）、ジラム（ziram）、シルチオファム（silthiofam）、ストレプトマイシン（streptomycin）、スピロキサミン（spiroxamine）、スルトロペン（sultropen）、セダキサン（sedaxane）、ゾキサミド（zoxamide）、ダゾメット（dazomet）、チアジアジン(thiadiazin)、チアジニル（tiadinil）、チアジフルオル（thiadifluor）、チアベンダゾール（thiabendazole）、チオキシミド（tioxymid）、チオクロルフェンフィム（thiochlorfenphim）、チオファネート（thiophanate）、チオファネートメチル（thiophanate-methyl）、チオフルザミド(thifluzamide)、チシオフェン（thicyofen）、チノキノックス（thioquinox）、チラム（thiram）、デカフェンチン（decafentin）、テクナゼン（tecnazene）、テクロフタラム（tecloftalam）、テコラム（tecoram）、テトラコナゾール（tetraconazole）、デバカルブ（debacarb）、デヒドロ酢酸（dehydroacetic acid）、テブコナゾール（tebuconazole）、テブフロキン（tebufloquin）、ドジシン（dodicin）、ドジン（dodine

）、ドデシルベンゼンスルホン酸ビスエチレンジアミン銅錯塩（II）(DBEDC）、ドデモルフ（dodemorph）、ドラゾキソロン（drazoxolon）、トリアジメノール（triadimenol）、トリアジメホン（triadimefon）、トリアズブチル（triazbutil）、トリアゾキシド（triazoxide）、トリアミホス（triamiphos）、トリアリモール（triarimol）、トリクラミド（trichlamide）、トリクロピリカルブ(triclopyricarb)、トリシクラゾール（tricyclazole）、トリチコナゾール（triticonazole）、トリデモルフ（tridemorph）、トリブチルチンオキシド（tributyltin oxide）、トリフルミゾール（triflumizole）、トリフロキシストロビン（trifloxystrobin）、
トリホリン（triforine）、トリルフルアラニド（tolylfluanid）、トルクロホスメチル（tolclofos-methyl）、トルプロカルブ(tolprocarb)、ナタマイシン（natamycin）、ナバム（nabam）、ニトロスチレン（nitrostyrene）、ニトロタサルイソプロピル（nitrothal-isopropyl）、ヌアリモール（nuarimol）、ノニルフェノールスルホン酸銅(copper nonylphenol sulfonate)、ハラクリネート（halacrinate）、バリダマイシン（validamycin）、バリフェナラート（valifenalate）、ハルピンタンパク(harpin protein)、ピカルブトラゾクス(picarbutrazox)、ビキサフェン（bixafen）、ピコキシストロビン（picoxystrobin）、ピコベンザミド(picobenzamide)、ビチオノール（bithionol）、ビテルタノール（bitertanol）、ヒドロキシイソキサゾール（hydroxyisoxazole）、ヒドロキシイソキサゾールカリウム(hydroisoxazole-potassium)、ビナパクリル（binapacryl）、ビフェニル（biphenyl）、ピペラリン（piperalin）、ヒメキサゾール（hymexazol）、ピラオキシストロビン（pyraoxystrobin）、ピラカルボリド（pyracarbolid）、ピラクロストロビン（pyraclostrobin）、ピラジフルミド(pyraziflumid)、ピラゾホス（pyrazophos）、ピラメトストロビン（pyrametostrobin）、ピリオフェノン（pyriofenone）、ピリジニトリル（pyridinitril）、ピリジフルメトフェン(pydiflumetofen)、ピリジフルメトフェン(pydiflumetofen)、ピリソキサゾール(pyrisoxazole)、ピリフェノックス（pyrifenox）、ピリベンカルブ（pyribencar

b)、ピリメタニル（pyrimethanil）、ピロキシクロル（pyroxychlor）、ピロキシフル（pyroxyfur）、ピロキロン（pyroquilon）、ビンクロゾリン（vinclozolin）、ファモキサドン（famoxadone）、フェナパニル（fenapanil）、フェナミドン（fenamidone）、フェナミノスルフ（fenaminosulf）、フェナミンストロビン(fenaminstrobin)、フェナリモール（fenarimol）、フェニトロパン（fenitropan）、フェノキサニル（fenoxanil）、フェリムゾン（ferimzone）、フェルバム（ferbam）、フェンチン（fentin）、フェンピクロニル（fenpiclonil）、フェンピラザミン（fenpyrazamine）、フェンブコナゾール（fenbuconazole）、フェンフラム（fenfuram）、フェンプロピジン（fenpropidin）、フェンプロピモルフ（fenpropimorph）、フェンヘキサミド（fenhexamid）、フタリド（phthalide）、ブチオベート（buthiobate）、ブチルアミン（butylamine）、ブピリメート（bupirimate）、フベリダゾール（fuberidazole）、ブラストサイジンＳ（blasticidin-S）、フラメトピル（furametpyr）、フララキシル（furalaxyl）、フルアクリピリム（fluacrypyrim）、フルアジナム（fluazinam）、フルオキサストロビン（fluoxastrobin）、フルオトリマゾール（fluotrimazole）、フルオピコリド（fluopicolide）、フルオピラム(fluopyram)、フルオロイミド（fluoroimide）、フルカルバニル（furcarbanil）、フルキサピロキサド（fluxapyroxad）、フルキンコナゾール（fluquinconazole）、フルコナゾール（furconazole）、フルコナゾール-シス（furconazole-cis）、フルジオキソニル（fludioxonil）、フルシラゾール（flusilazole）、フルスルファミド（flusulfamide）、フルチアニル（flutianil）、フルトラニル（flutolanil）、フルトリアホール（flutriafol）、フルフラール（furfural）、フルメシクロックス（furmecyclox）、フルメットベル（flumetover）、フルモルフ（flumorph）、プロキナジド（proquinazid）、プロクロラズ（prochloraz）、プロシミドン（procymidone）、プロチオカルブ（prothiocarb）、プロチオコナゾール（prothioconazole）、プロパモカルブ（propamocarb）、プロピコナゾール（propiconazole）、プロピネブ（propineb）、フロファネート（furophanate）、プロベナゾー

ル（probenazole）、ブロムコナゾール（bromuconazole）、ヘキサクロロブタジエン（hexachlorobutadiene）、ヘキサコナゾール（hexaconazole）、ヘキシルチオホス（hexylthiofos）、ベトキサジン（bethoxazin）、ベナラキシル（benalaxyl）、ベナラキシルＭ（benalaxyl-M）、ベノダニル（benodanil）、ベノミル（benomyl）、ペフラゾエート（pefurazoate）、ベンキノックス（benquinox）、ペンコナゾール（penconazole）、ベンザモルフ（benzamorf）、ペンシクロン（pencycuron）、ベンゾヒドロキサム酸（benzohydroxamic acid）、ベンゾビンジフルピル(benzovindiflupyr)、ベンタルロン（bentaluron）、ベンチアゾール(benthiazole）、ベンチアバリカルブ-イソプロピル(benthiavalicarb-isopropyl）、ペンチオピラド（penthiopyrad）、ペンフルフェン（penflufen）、ボスカリド（boscalid）、ホスジフェン（phosdiphen）、ホセチル（fosetyl）、ホセチルアルミニウム（fosetyl－Al）、ポリオキシン（polyoxins）、ポリオキソリン（polyoxorim）、ポリカーバメート(polycarbamate）、ホルペット（folpet）、ホルムアルデヒド（formaldehyde）、マシン油(machine oil）、マネブ（maneb）、マンコゼブ（mancozeb）、マンジプロパミド（mandipropamid）、マンデストロビン(mandestrobin)、ミクロゾリン（myclozolin）、ミクロブタニル（myclobutanil）、ミルディオマイシン(mildiomycin）、ミルネブ（milneb）、メカルビンジド（mecarbinzid）、メタスルホカルブ（methasulfocarb）、メタゾキソロン（metazoxolon）、メタム（metam）、メタムナトリウム塩（metam－sodium）、メタラキシル（metalaxyl）、メタラキシルＭ（metalaxyl-M）、メチラム（metiram）、メチルイソチオシアナート（methyl isothiocyanate）、メチルジノカップ（mepthyldinocap）、メトコナゾール（metconazole）、メトスルホバックス（metsulfovax）、メトフロキサム（methfuroxam）、メトミノストロビン（metominostrobin）、メトラフェノン（metrafenone）、メパニピリム（mepanipyrim）、メフェノキサム(mefenoxam）、メプチルジノカップ（meptyldinocap）、メプロニル（mepronil）、メベニル（mebenil）、ヨウ化メチル（iodomethane）、ラベンザゾール（rabenzazole）、臭化メチル（methyl bromid

e）、塩化ベンザルコニウム（benzalkonium chloride）、塩基性塩化銅（basic copper chloride）、塩基性硫酸銅（basic copper sulfate）、金属銀(silver）等の無機殺菌剤、次亜塩素酸ナトリウム(sodium hypochlorote）、水酸化第二銅（cupric hydroxide）、水和硫黄剤(wettable sulfur）、石灰硫黄合剤(calcium polysulfide）、炭酸水素カリウム(potassium hydrogen carbonate）、炭酸水素ナトリウム(sodium hydrogen carbonate）、無機硫黄(sulfur）、無水硫酸銅(copper sulfate anhydride）、ジメチルジチオカルバミド酸ニッケル(nickel dimethyldithiocarbamate）、8-ヒドロキシキノリン銅（oxine copper）のような銅系化合物、硫酸亜鉛(zinc sulfate）、硫酸銅五水塩(copper sulfate pentahydrate)等を例示することができる。

[0089] 同様の目的で使用する農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤としては例えば、3,5-xylyl methylcarbamate(XMC)、Bacillus thuringiensis aizawai、Bacillus thuringiensis israelensis、Bacillus thuringiensis japonensis、Bacillus thuringiensis kurstaki、Bacillus thuringiensis tenebrionis、Bacillus thuringiensisが生成する結晶タンパク毒素、BPMC、Btトキシン系殺虫性化合物、CPCBS(chlorfenson)、DCIP(dichlorodiisopropyl ether)、D-D(1, 3-Dichloropropene)、DDT、NAC、O-4-dimethylsulfamoylphenyl O, O-diethyl phosphorothioate(DSP)、O-ethyl O-4-nitrophenyl phenylphosphonothioate(EPN)、tripropylisocyanurate (TPIC)、アクリナトリン(acrinathrin)、アザディラクチン(azadirachtin)、アジンホス・メチル(azinphos-methyl)、アセキノシル(acequinocyl)、アセタミプリド(acetamiprid)、アセトプロール(acetoprole)、アセフェート(acephate)、アバメクチン(abamectin)、afidopyropen、アベルメクチン(avermectin-B)、アミドフルメット(amidoflumet)、アミトラズ(amitraz)、アラニカルブ(alanycarb)、アルジカルブ(aldicarb)、アルドキシカルブ(aldoxycarb)、アルドリン(aldrin)、アルファーエンドスルファン（alpha-endosulfan）、アルファシペルメトリン(alpha-cypermethrin)、アルベンダゾール(albendazole)、アレスリン(allethrin)、イサゾホス(isazofos)、イサミドホス(isamidofos)、イソアミドホス(isoamidofos)

、イソキサチオン(isoxathion)、イソフェンホス(isofenphos)、イソプロカルブ(isoprocarb: MIPC)、epsilon-metofluthrin、epsilon-momfluorothrin、イベルメクチン（ivermectin）、イミシアホス(imicyafos)、イミダクロプリド(imidaclоprid)、イミプロトリン(imiprothrin)、インドキサカルブ(indoxacarb)、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、エチオフェンカルブ(ethiofencarb)、エチオン(ethion)、エチプロール(ethiprole)、エトキサゾール(etoxazole)、エトフェンプロックス(ethofenprox)、エトプロホス(ethoprophos)、エトリムホス(etrimfos)、エマメクチン（emamectin）、エマメクチンベンゾエート(emamectin-benzoate)、エンドスルファン(endosulfan)、エンペントリン(empenthrin)、オキサミル(oxamyl)、オキシジメトン・メチル(oxydemeton-methyl)、オキシデプロホス(oxydeprofos: ESP)、オキシベンダゾール(oxibendazole)、オクスフェンダゾール(oxfendazole)、オレイン酸カリウム(Potassium oleate)、オレイン酸ナトリウム(sodium oleate)、カズサホス(cadusafos)、kappa-bifenthrin、カルタップ(cartap)、カルバリル(carbaryl)、カルボスルファン(carbosulfan)、カルボフラン(carbofuryl)、ガンマシハロトリン(gamma-cyhalothrin)、キシリルカルブ(xylylcarb)、キナルホス(quinalphos)、キノプレン(kinoprene)、キノメチオネート(chinomethionat)、クロエトカルブ(cloethocarb)、クロチアニジン(clothianidin)、クロフェンテジン(clofentezine)、クロマフェノジド(chromafenozide)、クロラントラニリプロール(chlorantraniliprole)、クロルエトキシホス(chlorethoxyfos)、クロルジメホルム（chlordimeform）、クロルデン(chlordane)、クロルピリホス(chlorpyrifos)、クロルピリホス-メチル(chlorpyrifos-methyl)、クロルフェナピル(chlorphenapyr)、クロルフェンソン(chlorfenson)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、クロルベンジレート(chlorobenzilate)、クロロベンゾエート（chlorobenzoate）、chloroprallethrin、ケルセン(ジコホル: dicofol)、サリチオン(salithion)、cyhalodiamide、シアノホス(cyanophos: CYAP)、ジアフェンチウロン(diafenthiuron)、ジアミダホス(diamidafos)、シアントラニリプロー

ル（cyantraniliprole）、シータ-シペルメトリン（theta-cypermethrin）、ジエノクロル(dienochlor)、シエノピラフェン(cyenopyrafen)、ジオキサベンゾホス(dioxabenzofos)、ジオフェノラン(diofenolan)、シグマ-サイパーメトリン(sigma-cypermethrin)、cyclaniliprole、ジクロフェンチオン(dichlofenthion: ECP)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、ジクロルボス(dichlorvos: DDVP)、ジスルホトン(disulfoton)、ジノテフラン(dinotefuryl)、シハロトリン(cyhalothrin)、シフェノトリン(cyphenothrin)、シフルトリン(cyfluthrin)、ジフルベンズロン(diflubenzuron)、シフルメトフェン(cyflumetofen)、ジフロビダジン（diflovidazin）、シヘキサチン(cyhexatin)、シペルメトリン(cypermethrin)、ジメチルビンホス(dimethylvinphos)、ジメトエート(dimethoate)、ジメフルスリン（dimefluthrin）、シラフルオフェン(silafluofen)、シロマジン(cyromazine)、スピネトラム(spinetoram)、スピノサッド(spinosad)、スピロジクロフェン(spirodiclofen)、スピロテトラマト(spirotetramat)、スピロメシフェン(spiromesifen)、スルフルラミド(sulfluramid)、スルプロホス(sulprofos)、スルホキサフロール（sulfoxaflor）、ゼータ-シペルメトリン(zeta-cypermethrin)、ダイアジノン(diazinon)、タウフルバリネート(tau-fluvalinate)、ダゾメット(dazomet)、チアクロプリド(thiacloprid)、チアメトキサム(thiamethoxam)、tioxazafen、チオジカルブ(thiodicarb)、チオシクラム(thiocyclam)、チオスルタップ(thiosultap)、チオスルタップナトリウム（thiosultap-sodium）、チオナジン(thionazin)、チオメトン(thiometon)、ディート（deet）、ディルドリン(dieldrin)、テトラクロルビンホス(tetrachlorvinphos)、テトラジホン(tetradifon)、tetraniliprole、テトラメチルフルトリン（tetramethylfluthrin）、テトラメトリン(tetramethrin)、テブピリムホス(tebupirimfos)、テブフェノジド(tebufenozide)、テブフェンピラド(tebufenpyrad)、テフルトリン(tefluthrin)、テフルベンズロン(teflubenzuron)、デメトン-Ｓ-メチル（demeton-S-methyl）、テメホス(temephos)、デルタメトリン(deltamethrin)、テルブホス(terbufos)、トラロピリル(tralopyril)、トラロメトリン(tralomethrin)、トラ

ンスフルトリン(transfluthrin)、トリアザメート(triazamate)、トリアズロン(triazuron)、トリクラミド(trichlamide)、トリクロルホン(trichlorphon : DEP)、triflumezopyrim、トリフルムロン(triflumuron)、トルフェンピラド(tolfenpyrad)、ナレッド(naled: BRP)、ニチアジン (nithiazine) 、ニテンピラム(nitenpyram)、ノバルロン(novaluron)、ノビフルムロン(noviflumuron)、ハイドロプレン(hydroprene)、バニリプロール(vaniliprole)、バミドチオン(vamidothion)、パラチオン(parathion)、パラチオン-メチル (parathion-methyl) 、ハルフェンプロックス(halfenprox)、ハロフェノジド(halofenozide)、ビストリフルロン(bistrifluron)、ビスルタップ(bisultap)、ヒドラメチルノン(hydramethylnon)、ヒドロキシプロピルデンプン(hydroxy propyl starch)、ビナパクリル(binapacryl)、ピフルブミド(pyflubumide)、ビフェナゼート(bifenazate)、ビフェントリン(bifenthrin)、ピメトロジン(pymetrozine)、ピラクロホス(pyraclorfos)、ピラフルプロール (pyrafluprole) 、ピリダフェンチオン(pyridafenthion)、ピリダベン(pyridaben)、ピリダリル(pyridalyl)、ピリフルキナゾン(pyrifluquinazon)、ピリプロール(pyriprole)、ピリプロキシフェン(pyriproxyfen)、ピリミカーブ(pirimicarb)、ピリミジフェン(pyrimidifen)、pyriminostrobin、ピリミホスメチル(pirimiphos-methyl)、ピレトリン(pyrethrins)、フィプロニル(fipronil)、フェナザキン(fenazaquin)、フェナミフォス(fenamiphos)、フェニソブロモレート(bromopropylate)、フェニトロチオン(fenitrothion: MEP)、フェノキシカルブ(fenoxycarb)、フェノチオカルブ(fenothiocarb)、フェノトリン(phenothrin) 、フェノブカルブ(fenobucarb)、フェンスルフォチオン(fensulfothion)、フェンチオン(fenthion: MPP)、フェントエート(phenthoate: PAP)、フェンバレレート(fenvalerate)、フェンピロキシメート(fenpyroximate)、フェンプロパトリン(fenpropathrin)、フェンベンダゾール(fenbendazole)、フォスチアゼート(fosthiazate)、フォルメタネート(formetanate)、ブタチオホス(butathiofos) 、ブプロフェジン(buprofezin)、フラチオカルブ(furathiocarb) 、プラレトリン(prallethrin)、フルアクリピリム(fluacrypyrim)、fluazain

dolizine、フルアジナム(fluazinam)、フルアズロン(fluazuron)、フルエンスルホン (fluensulfone) 、fluxametamide、フルシクロクスロン(flucycloxuron)、フルシトリネート(flucythrinate)、フルバリネート(fluvalinate)、flufiprole 、flupyradifurone、フルピラゾホス(flupyrazofos)、フルフェネリム(flufenerim)、flufenoxystrobin、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、フルフェンジン(flufenzine)、フルフェンプロックス(flufenoprox)、フルプロキシフェン(fluproxyfen)、フルブロシスリネート(flubrocythrinate)、fluhexafon、フルベンジアミド(flubendiamide)、フルメトリン(flumethrin)、フルリムフェン(flurimfen)、プロチオホス(prothiofos)、プロトリフェンブト(protrifenbute)、フロニカミド(flonicamid)、プロパホス(propaphos)、プロパルギット(propargite: BPPS)、プロフェノホス(profenofos)、プロフルスリン (profluthrin) 、プロポキスル(propoxur: PHC)、flometoquin、ブロモプロピレート(bromopropylate)、ベーター-シフルトリン(beta-cyfluthrin)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ヘキシチアゾクス(hexythiazox)、heptafluthrin、ヘプテノホス(heptenophos)、ペルメトリン(permethrin)、ベンクロチアズ(benclothiaz)、ベンジオカルブ(bendiocarb)、ベンスルタップ(bensultap)、ベンゾキシメート(benzoximate)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、ホキシム(phoxim)、ホサロン(phosalone)、ホスチアゼート(fosthiazate)、ホスチエタン(fosthietan)、ホスファミドン (phosphamidon) 、ホスホカルブ(phosphocarb)、ホスメット(phosmet: PMP)、ポリナクチン複合体(polynactins)、ホルメタネート(formetanate)、ホルモチオン(formothion)、ホレート(phorate)、マシン油(machine oil)、マラチオン(malathion)、ミルベマイシン (milbemycin) 、ミルベマイシンA(milbemycin-A)、ミルベメクチン(milbemectin)、メカルバム(mecarbam)、メスルフェンホス(mesulfenfos)、メソミル(methomyl)、メタアルデヒド (metaldehyde) 、メタフルミゾン(metaflumizone)、メタミドホス(methamidophos)、メタム・アンモニウム(metam-ammonium)、メタム・ナトリウム(metam-sodium)、メチオカルブ(methiocarb)、メチダチオン(methidathion: DMTP)、メチルイソチオシアネート(methylisot

hiocyanate)、メチルネオデカナミド(methylneodecanamide)、メチルパラチオン(methylparathion)、メトキサジアゾン(metoxadiazone)、メトキシクロル(methoxychlor)、メトキシフェノジド(methoxyfenozide)、メトフルトリン(metofluthrin)、メトプレン(methoprene)、メトルカルブ(metolcarb)、メルフルスリン（meperfluthrin）、メビンホス(mevinphos)、モノクロトホス(monocrotophos)、モノスルタップ(monosultap)、momfluorothrin、ラムダ-シハロトリン(lambda-cyhalothrin)、リアノジン（ryanodine）、ルフェヌロン(lufenuron)、rescalure、レスメトリン(resmethrin)、レピメクチン(lepimectin)、ロテノン(rotenone)、塩酸レバミゾール(levamisol hydrochloride)、酸化フェンブタスズ(fenbutatin oxide)、酒石酸モランテル(morantel tartarate)、臭化メチル(methyl bromide)、水酸化トリシクロヘキシルスズ(cyhexatin)、石灰窒素(calcium cyanamide)、石灰硫黄合剤(calcium polysulfide)、硫黄(sulfur)、及び硫酸ニコチン(nicotine-sulfate)等を例示することができる。

[0090] 同様の目的で使用する除草剤としては例えば、1-ナフチルアセトアミド、2,4-PA、2,3,6-TBA、2,4,5-T、2,4,5-TB、2,4-D、2,4-DB、2,4-DEB、2,4-DEP、3,4-DA、3,4-DB、3,4-DP、4-CPA、4-CPB、4-CPP、MCP、MCPA、MCPAチオエチル、MCPB、アイオキシニル（ioxynil）、アクロニフェン（aclonifen）、アザフェニジン（azafenidin）、アシフルオルフェン（acifluorfen）、アジプロトリン（aziprotryne）、アジムスルフロン（azimsulfuron）、アシュラム（asulam）、アセトクロール（acetochlor）、アトラジン（atrazine）、アトラトン（atraton）、アニスロン（anisuron）、アニロホス（anilofos）、アビグリシン(aviglycine)、アブシジン酸(abscisic acid)、アミカルバゾン（amicarbazone）、アミドスルフロン（amidosulfuron）、アミトロール（amitrole）、アミノシクロピラクロール（aminocyclopyrachlor）、アミノピラリド（aminopyralid）、アミブジン（amibuzin）、アミプロホスメチル（amiprophos-methyl）、アメトリジオン（ametridione）、アメトリン（ametryn）、アラクロール（alachlor）、アリドクロール（allidochlor）、アロキ

シジム（alloxydim）、アロラック（alorac）、イオフェンスルフロン（iofensulfuron）、イソウロン（isouron）、イソカルバミド（isocarbamid）、イソキサクロルトール（isoxachlortole）、イソキサピリホップ（isoxapyrifop）、イソキサフルトール（isoxaflutole）、イソキサベン（isoxaben）、イソシル（isocil）、イソノルロン（isonoruron）、イソプロツロン（isoproturon）、イソプロパリン（isopropalin）、イソポリナート（isopolinate）、イソメチオジン（isomethiozin）、イナベンフィド(inabenfide)、イパジン（ipazine）、イプフェンカルバゾン（ipfencarbazone）、イプリミダム（iprymidam）、イマザキン（imazaquin）、イマザピック（imazapic）、イマザピル（imazapyr）、イマザメタピル(imazamethapyr)、イマザメタベンズ（imazamethabenz）、イマザメタベンズメチル(imazamethabenz-methyl)、イマザモックス（imazamox）、イマゼタピル（imazethapyr）、イマゾスルフロン（imazosulfuron）、インダジフラム（indaziflam）、インダノファン（indanofan）、インドール酪酸(indolebutyric acid)、ウニコナゾール-P(uniconazole-P)、エグリナジン（eglinazine）、エスプロカルブ（esprocarb）、エタメスルフロン（ethametsulfuron）、エタメトスルフロンメチル(ethametsulfuron-methyl)、エタルフルラリン（ethalfluralin）、エチオレート（ethiolate）、エチクロゼート-エチル(ethychlozate ethyl)、エチジムロン（ethidimuron）、エチノフェン（etinofen）、エテホン(ethephon)、エトキシスルフロン（ethoxysulfuron）、エトキシフェン（ethoxyfen）、エトニプロミド（etnipromid）、エトフメセート（ethofumesate）、エトベンザニド（etobenzanid）、エプロナズ（epronaz）、エルボン（erbon）、エンドタール（endothal）、オキサジアゾン（oxadiazon）、オキサジアルギル（oxadiargyl）、オキサジクロメホン（oxaziclomefone）、オキサスルフロン（oxasulfuron）、オキサピラゾン（oxapyrazon）、オキシフルオルフェン（oxyfluorfen）、オリザリン（oryzalin）、オルソスルファムロン（orthosulfamuron）、オルベンカルブ（orbencarb）、カフェンストロール（cafenstrole）、カムベンジクロール（cambendichlor）、カルバスラム（carbasulam）、カルフェ

ントラゾン（carfentrazone）、カルフェントラゾン-エチル(carfentrazone-ethyl)、カルブチレート（karbutilate）、カルベタミド（carbetamide）、カルボキサゾール（carboxazole）、キザロホップ（quizalofop）、キザロホップ-P（quizalofop-P）、キザロホップ-エチル(quizalofop-ethyl)、キシラクロール（xylachlor）、キノクラミン（quinoclamine）、キノナミド（quinonamid）、キンクロラック（quinclorac）、キンメラック（quinmerac）、クミルロン（cumyluron）、クリオジネート（cliodinate）、グリホサート(glyphosate)、グルホシネート（glufosinate）、グルホシネート-P（glufosinate-P）、クレダジン（credazine）、クレトジム（clethodim）、クロキシホナック(cloxyfonac)、クロジナホップ（clodinafop）、クロジナホップ-プロパルギル(clodinafop-propargyl)、クロトルロン（chlorotoluron）、クロピラリド（clopyralid）、クロプロキシジム（cloproxydim）、クロプロップ（cloprop）、クロブロムロン（chlorbromuron）、クロホップ（clofop）、クロマゾン（clomazone）、クロメトキシニル(chlomethoxyni1)、クロメトキシフェン（chlomethoxyfen）、クロメプロップ（clomeprop）、クロラジホップ（chlorazifop）、クロラジン（chlorazine）、クロラスラム（cloransulam）、クロラノクリル（chloranocryl）、クロラムベン（chloramben）、クロランスラム-メチル(cloransulam-methyl)、クロリダゾン（chloridazon）、クロリムロン（chlorimuron）、クロリムロン-エチル(chlorimuron-ethyl)、クロルスルフロン（chlorsulfuron）、クロルタール（chlorthal）、クロルチアミド（chlorthiamid）、クロルトルロン(chlortoluron)、クロルニトロフェン（chlornitrofen）、クロルフェナック（chlorfenac）、クロルフェンプロップ（chlorfenprop）、クロルブファム（chlorbufam）、クロルフルラゾール（chlorflurazole）、クロルフルレノール（chlorflurenol）、クロルプロカルブ（chlorprocarb）、クロルプロファム（chlorpropham）、クロルメコート(chlormequat)、クロレツロン（chloreturon）、クロロキシニル（chloroxynil）、クロロクスロン（chloroxuron）、クロロポン（chloropon）、サフルフェナシル（saflufenacil）、シアナジン（cyanazine）、シアナト

リン（cyanatryn）、ジアレート(di-allate)、ジウロン（diuron）、ジエタムコート（diethamquat）、ジカンバ（dicamba）、シクルロン（cycluron）、シクロエート（cycloate）、シクロキシジム（cycloxydim）、ジクロスラム（diclosulam）、シクロスルファムロン（cyclosulfamuron）、シクロピリモレート（cyclopyrimorate）、ジクロプロップ（dichlorprop）、ジクロプロップ-P（dichlorprop-P）、ジクロベニル（dichlobenil）、ジクロホップ（diclofop）、ジクロホップメチル(diclofop-methyl)、ジクロメート（dichlormate）、ジクロラルウレア（dichloralurea）、ジクワット（diquat）、シサニリド（cisanilide）、ジスル（disul）、シズロン（siduron）、ジチオピル（dithiopyr）、ジニトラミン（dinitramine）、シニドンエチル（cinidon-ethyl）、ジノサム（dinosam）、シノスルフロン（cinosulfuron）、ジノセブ（dinoseb）、ジノテルブ（dinoterb）、ジノフェナート（dinofenate）、ジノプロップ（dinoprop）、シハロホップブチル（cyhalofop-butyl）、ジフェナミド（diphenamid）、ジフェノクスロン（difenoxuron）、ジフェノペンテン（difenopenten）、ジフェンゾコート（difenzoquat）、シブトリン（cybutryne）、シプラジン（cyprazine）、シプラゾール（cyprazole）、ジフルフェニカン（diflufenican）、ジフルフェンゾピル（diflufenzopyr）、ジプロペトリン（dipropetryn）、シプロミド（cypromid）、シペルコート（cyperquat）、ジベレリン(gibberellin)、シマジン（simazine）、ジメキサノ（dimexano）、ジメタクロール（dimethachlor）、ジメダゾン（dimidazon）、ジメタメトリン（dimethametryn）、ジメテナミド（dimethenamid）、シメトリン（simetryn）、シメトン（simeton）、ジメピペレート（dimepiperate）、ジメフロン（dimefuron）、シンメチリン（cinmethylin）、スエップ（swep）、スルグリカピン（sulglycapin）、スルコトリオン（sulcotrione）、スルファレート（sulfallate）、スルフェントラゾン（sulfentrazone）、スルホスルフロン（sulfosulfuron）、スルホメツロン（sulfometuron）、スルホメツロンメチル(sulfometuron-methyl)、セクブメトン（secbumeton）、セトキシジム（sethoxydim）、セブチラジン（sebuthylazine）、ターバシ

ル(terbacil)、ダイムロン（daimuron）、ダゾメット（dazomet）、ダラポン（dalapon）、チアザフルロン（thiazafluron）、チアゾピル（thiazopyr）、チアフェナシル（tiafenacil）、チエンカルバゾン（thiencarbazone）、チエンカルバゾンメチル(thiencarbazone-methyl)、チオカルバジル（tiocarbazil）、チオクロリム（tioclorim）、チオベンカルブ（thiobencarb）、チジアジミン（thidiazimin）、チジアズロン（thidiazuron）、チフェンスルフロン（thifensulfuron）、チフェンスルフロンメチル(thifensulfuron-methyl)、デスメディファム（desmedipham）、デスメトリン（desmetryn）、テトラフルロン（tetrafluron）、テニルクロール（thenylchlor）、テブタム（tebutam）、テブチウロン（tebuthiuron）、テルブメトン（terbumeton）、テプラロキシジム（tepraloxydim）、テフリールトリオン（tefuryltrione）、テムボトリオン（tembotrione）、デラクロール（delachlor）、テルバシル（terbacil）、テルブカルブ（terbucarb）、テルブクロール（terbuchlor）、テルブチラジン（terbuthylazine）、テルブトリン（terbutryn）、トプラメゾン（topramezone）、トラルコキシジム（tralkoxydim）、トリアジフラム（triaziflam）、トリアスルフロン（triasulfuron）、トリアファモン（triafamone）、トリアレート(tri-allate)、トリエタジン（trietazine）、トリカンバ（tricamba）、トリクロピル（triclopyr）、トリジファン（tridiphane）、トリタック（tritac）、トリトスルフロン（tritosulfuron）、トリフルジモキサジン（trifludimoxazin）、トリフルスルフロン（triflusulfuron）、トリフルスルフロンメチル(triflusulfuron-methyl)、トリフルラリン（trifluralin）、トリフロキシスルフロン（trifloxysulfuron）、トリプロピンダン（tripropindan）、トリベニュロンメチル(tribenuron-methyl)、トリベヌロン（tribenuron）、トリホップ（trifop）、トリホプシメ（trifopsime）、トリメツロン（trimeturon）、トルピラレート（tolpyralate）、ナプタラム（naptalam）、ナプロアニリド（naproanilide）、ナプロパミド（napropamide）、ニコスルフロン（nicosulfuron）、ニトラリン（nitralin）、ニトロフェン（nitrofen）、ニトロフルオルフェン（nitrofluorfen

）、ニピラクロフェン（nipyraclofen）、ネブロン（neburon）、ノルフルラゾン（norflurazon）、ノルロン（noruron）、バーバン（barban）、パクロブトラゾール(paclobutrazol)、パラコート（paraquat）、パラフルロン（parafluron）、ハロキシジン（haloxydine）、
ハロキシフェン（halauxifen）、ハロキシホップ（haloxyfop）、ハロキシホップ-P（haloxyfop-P）、ハロキシホップメチル(haloxyfop-methyl)、ハロサフェン（halosafen）、ハロスルフロン（halosulfuron）、ハロスルフロンメチル（halosulfuron-methyl）、ピクロラム（picloram）、ピコリナフェン（picolinafen）、ビシクロピロン（bicyclopyrone）、ビスピリバック（bispyribac）、ビスピリバックナトリウム(bispyribac-sodium)、ピダノン（pydanon）、ピノキサデン（pinoxaden）、ビフェノックス（bifenox）、ピペロホス（piperophos）、ヒメキサゾール(hymexazol)、ピラクロニル（pyraclonil）、ピラスルホトール（pyrasulfotole）、ピラゾキシフェン（pyrazoxyfen）、ピラゾスルフロン（pyrazosulfuron）、ピラゾスルフロンエチル（pyrazosulfuron-ethyl）、ピラゾレート（pyrazolate）、ビラナホス（bilanafos）、ピラフルフェンエチル（pyraflufen-ethyl）、ピリクロール（pyriclor）、ピリダホール（pyridafol）、ピリチオバック（pyrithiobac）、ピリチオバックナトリウム(pyrithiobac-sodium)、ピリデート（pyridate）、ピリフタリド（pyriftalid）、ピリブチカルブ（pyributicarb）、ピリベンゾキシム（pyribenzoxim）、ピリミスルファン（pyrimisulfan）、ピリミスルフロン（primisulfuron）、ピリミノバックメチル（pyriminobac-methyl）、ピロキサスルホン（pyroxasulfone）、ピロクスラム（pyroxsulam）、フェナスラム（fenasulam）、フェニソファム（phenisopham）、フェヌロン（fenuron）、フェノキサスルホン（fenoxasulfone）、フェノキサプロップ（fenoxaprop）、フェノキサプロップ-P（fenoxaprop-P）、フェノキサプロップエチル(fenoxaprop-ethyl)、フェノチオール(phenothiol)、フェノプロップ（fenoprop）、フェノベンズロン（phenobenzuron）、フェンキノトリオン（fenquinotrione）、フェンチアプロップ（fenthiaprop）、フェンテラコール（fente

racol）、フェントラザミド（fentrazamide）、フェンメディファム（phenmedipham）、フェンメディファムエチル（phenmedipham-ethyl）、ブタクロール（butachlor）、ブタフェナシル（butafenacil）、ブタミホス（butamifos）、ブチウロン（buthiuron）、ブチダゾール（buthidazole）、ブチレート（butylate）、ブツロン（buturon）、ブテナクロール（butenachlor）、ブトキシジム（butroxydim）、ブトラリン（butralin）、フラザスルフロン（flazasulfuron）、フラムプロップ（flamprop）、フリロオキシフェン（furyloxyfen）、プリナクロール（prynachlor）、プリミスルフロンメチル(primisulfuron-methyl)、フルアジホップ（fluazifop）、フルアジホップ-P（fluazifop-P）、フルアジホップブチル(fluazifop-butyl)、フルアゾレート（fluazolate）、フルロキシピル（fluroxypyr）、フルオチウロン（fluothiuron）、フルオメツロン(fluometuron)、フルオログリコフェン（fluoroglycofen）、フルロクロリドン（flurochloridone）、フルオロジフェン（fluorodifen）、フルオロニトロフェン（fluoronitrofen）、フルオロミジン（fluoromidine）、フルカルバゾン（flucarbazone）、フルカルバゾンナトリウム(flucarbazone-sodium)、フルクロラリン（fluchloralin）、フルセトスルフロン（flucetosulfuron）、フルチアセット（fluthiacet）、フルチアセットメチル(fluthiacet-methyl)、フルピルスルフロン（flupyrsulfuron）、フルフェナセット（flufenacet）、フルフェニカン（flufenican）、フルフェンピル（flufenpyr）、フルプロパシル（flupropacil）、フルプロパナート（flupropanate）、フルポキサム（flupoxam）、フルミオキサジン（flumioxazin）、フルミクロラック（flumiclorac）、フルミクロラックペンチル(flumiclorac-pentyl)、フルミプロピン（flumipropyn）、フルメジン（flumezin）、フルオメツロン（fluometuron）、フルメトスラム（flumetsulam）、フルリドン（fluridone）、フルルタモン（flurtamone）、フルロキシピル(fluroxypyr)、プレチラクロール（pretilachlor）、プロキサン（proxan）、プログリナジン（proglinazine）、プロシアジン（procyazine）、プロジアミン（prodiamine）、プロスルファリン（prosulfalin）、プロスルフロン（prosulfur

on）、プロスルホカルブ（prosulfocarb）、プロパキザホップ（propaquizafop）、プロパクロール（propachlor）、プロパジン（propazine）、プロパニル（propanil）、プロピザミド（propyzamide）、プロピソクロール（propisochlor）、プロヒドロジャスモン(prohydrojasmon)、プロピリスルフロン（propyrisulfuron）、プロファム（propham）、プロフルアゾール（profluazol）、プロフルラリン（profluralin）、プロヘキサジオンカルシウム(prohexadione-calcium)、プロポキシカルバゾン（propoxycarbazone）、プロポキシカルバゾンナトリウム(propoxycarbazone-sodium)、プロホキシジム（profoxydim）、ブロマシル（bromacil）、ブロムピラゾン（brompyrazon）、プロメトリン（prometryn）、プロメトン（prometon）、ブロモキシニル（bromoxynil）、ブロモフェノキシム（bromofenoxim）、ブロモブチド（bromobutide）、ブロモボニル（bromobonil）、フロラスラム（florasulam）、フロルピロキシフェン（florpyrauxifen）、ヘキサクロロアセトン（hexachloroacetone）、ヘキサジノン（hexazinone）、ペトキサミド（pethoxamid）、ベナゾリン（benazolin）、ペノクスラム（penoxsulam）、ペブレート（pebulate）、ベフルブタミド（beflubutamid）、ベルノレート（vernolate）、ペルフルイドン（perfluidone）、ベンカルバゾン（bencarbazone）、ベンザドックス（benzadox）、ベンジプラム（benzipram）、ベンジルアミノプリン(benzylaminopurine)、ベンズチアズロン（benzthiazuron）、ベンズフェンジゾン（benzfendizone）、ベンスリド（bensulide）、ベンスルフロンメチル（bensulfuron-methyl）、ベンゾイルプロップ（benzoylprop）、ベンゾビシクロン（benzobicyclon）、ベンゾフェナップ（benzofenap）、ベンゾフルオール（benzofluor）、ベンタゾン（bentazone）、ペンタノクロール（pentanochlor）、ベンチオカーブ(benthiocarb)、ペンディメタリン（pendimethalin）、ペントキサゾン（pentoxazone）、ベンフラリン（benfluralin）、ベンフレセート（benfuresate）、ホサミン（fosamine）、ホメサフェン（fomesafen）、ホラムスルフロン（foramsulfuron）、ホルクロルフェニュロン(forchlorfenuron)、マレイン酸ヒドラジド(maleic hydrazide)、メコプロップ（mecoprop

）、メコプロップ-Ｐ（mecoprop-P）、メジノテルブ（medinoterb）、メソスルフロン（mesosulfuron）、メソスルフロンメチル(mesosulfuron-methyl)、メソトリオン（mesotrione）、メソプラジン（mesoprazine）、メソプロトリン（methoprotryne）、メタザクロール（metazachlor）、メタゾール（methazole）、メタゾスルフロン（metazosulfuron）、メタベンズチアズロン（methabenzthiazuron）、メタミトロン（metamitron）、メタミホップ（metamifop）、メタム（metam）、メタルプロパリン（methalpropalin）、メチウロン（methiuron）、メチオゾリン(methiozolin)、メチオベンカルブ（methiobencarb）、メチルダイムロン（methyldymron）、メトクスロン（metoxuron）、メトスラム（metosulam）、メトスルフロン（metsulfuron）、メトスルフロンメチル(metsu1furon-methy1)、メトフラゾン（metflurazon）、メトブロムロン（metobromuron）、メトベンズロン（metobenzuron）、メトメトン（methometon）、メトラクロール（metolachlor）、メトリブジン（metribuzin）、メピコートクロリド(mepiquat-chloride)、メフェナセット（mefenacet）、メフルイジド（mefluidide）、モナリド（monalide）、モニソウロン（monisouron）、モニュヌロン（monuron）、モノクロル酢酸（monochloroacetic acid）、モノリニュヌロン（monolinuron）、モリネート（molinate）、モルファムコート（morfamquat）、ヨードスルフロン（iodosulfuron）、ヨードスルフロンメチルナトリウム(iodosulfuron-methyl-sodium)、ヨードボニル（iodobonil）、ヨードメタン（iodomethane）、ラクトフェン（lactofen）、リヌロン（linuron）、リムスルフロン（rimsulfuron）、レナシル（lenacil）、ローデタニル（rhodethanil）、過酸化カルシウム(calcium peroxide)、臭化メチル（methyl bromide）等を例示することができる。

[0091] また、生物農薬としては例えば、核多角体ウイルス（Nuclear polyhedrosis virus、NPV）、顆粒病ウイルス（Granulosis virus、GV）、細胞質多角体病ウイルス（Cytoplasmic polyhedrosis virus、CPV）、昆虫ポックスウイルス（Entomopoxi virus 、EPV）等のウイルス製剤、モノクロスポリウム・フィマトパガム（Monacrosporium phymatophagum）、スタイナーネマ・カーポ

カプサエ（Steinernema carpocapsae）、スタイナーネマ・クシダエ（Steinernema kushidai）、パスツーリア・ペネトランス（Pasteuria penetrans）等の殺虫又は殺線虫剤として利用される微生物農薬、トリコデルマ・リグノラン（Trichoderma lignorum）、アグロバクテリウウム・ラジオバクター（Agrobacterium radiobactor）、非病原性エルビニア・カロトボーラ（Erwinia carotovora）、バチルス・ズブチリス（Bacillus subtilis）等の殺菌剤として使用される微生物農薬、ザントモナス・キャンペストリス（Xanthomonas campestris）等の除草剤として利用される生物農薬などと混合して使用することにより、同様の効果が期待できる。

[0092] 更に、生物農薬としては例えば、オンシツツヤコバチ（Encarsia formosa）、コレマンアブラバチ（Aphidius colemani）、ショクガタマバエ（Aphidoletes aphidimyza）、イサエアヒメコバチ（Diglyphus isaea）、ハモグリコマユバチ（Dacnusa sibirica）、チリカブリダニ（Phytoseiulus persimilis）、ククメリスカブリダニ（Amblyseius cucumeris）、ナミヒメハナカメムシ（Orius sauteri）等の天敵生物、ボーベリア・ブロンニアティ（Beauveria brongniartii）等の微生物農薬、（Ｚ）－１０－テトラデセニル＝アセタート、（Ｅ，Ｚ）－４，１０－テトラデカジニエル＝アセタート、（Ｚ）－８－ドデセニル＝アセタート、（Ｚ）－１１－テトラデセニル＝アセタート、（Ｚ）－１３－イコセン－１０－オン、１４－メチル－１－オクタデセン等のフェロモン剤と併用することも可能である。

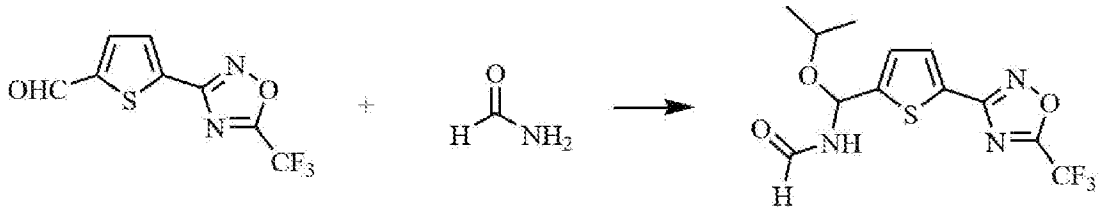
[0093] 以下に本発明の化合物の製造方法の代表的な実施例を例示するが、本発明の化合物の製造方法はこれらに限定されるものではない。

実施例

[0094] 製造実施例１

Ｎ－（イソプロポキシ｛５－［５－（トリフルオロメチル）－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル］チオフェン－２－イル｝メチル）ホルムアミドの製造（化合物１－４）

[化4]



５－[５－（トリフルオロメチル）－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル]チオフェン－２－カルボアルデヒド（０．３５ｇ，１．４ｍｍｏｌ）をアルゴン雰囲気下、クロロホルム（１０ｍＬ）に溶かし、ホルムアミド（０．０７６ｇ，１．７ｍｍｏｌ）、チタン（ＩＶ）イソプロポキシド（０．７２ｇ，２．５ｍｍｏｌ）を加え、室温で２４時間静置した。その後、酢酸エチルで希釈し、シリカゲルを加え２５分間攪拌した後、減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製することで、表題の化合物（０．０６ｇ，０．１９ｍｍｏｌ）を得た。

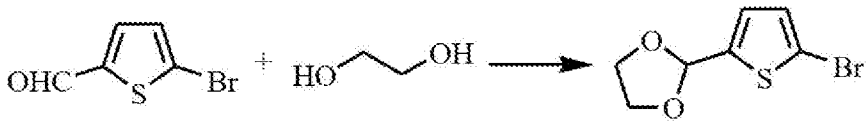
収率：１４％

物性値：融点１０１－１０２℃

[0095] 参考例１

２－（５－ブロモチオフェン－２－イル）－１，３－ジオキソランの製造

[化5]



５－ブロモチオフェン－２－カルボアルデヒド（１３ｇ，６８ｍｍｏｌ）をトルエン（１２０ｍＬ）に溶かし、エチレングリコール（１７ｇ，２７２ｍｍｏｌ）、ｐ－トルエンスルホン酸一水和物　（１．３ｇ，６．８ｍｍｏｌ）を加え、ディーンスターク装置を用いて水を除去しながら４時間加熱還流した。反応終了後、室温に戻し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて反応を停止し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮することで、表題の化合物（１７ｇ，７１ｍ

ｍｏｌ）を得た。

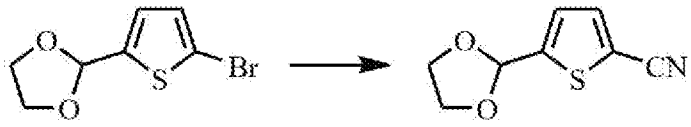
収率：１０４％

物性値：屈折率１．３４３２（２４．６）

[0096] 参考例２

５－（１，３－ジオキソラン－２－イル）チオフェン－２－カルボニトリルの製造

[化6]



２－（５－ブロモチオフェン－２－イル）－１，３－ジオキソラン（１７ｇ，７１ｍｍｏｌ）をＤＭＡ（３５ｍＬ）に溶かし、シアン化銅（Ｉ）（７．０ｇ，７８ｍｍｏｌ）を加え、１５０℃で５．５時間加熱攪拌した。反応終了後、室温に戻し、セライトろ過した。４％アンモニア水溶液を加えて反応を停止し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製することで、表題の化合物（６．５ｇ，３６ｍｍｏｌ）を得た。

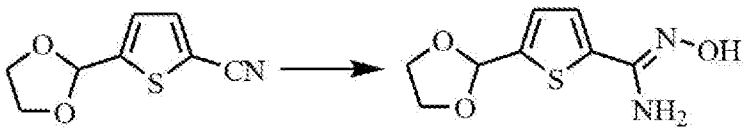
収率：５０％

物性値：屈折率１．３４５４（２３．０）

[0097] 参考例３

（Ｚ）－５－（１，３－ジオキソラン－２－イル）－Ｎ’－ヒドロキシチオフェン－２－カルボキシイミダミドの製造

[化7]



５－（１，３－ジオキソラン－２－イル）チオフェン－２－カルボニトリル（６．５ｇ，３６ｍｍｏｌ）をエタノール（７０ｍＬ）に溶かし、トリエ

チルアミン（５．４ｇ，５４ｍｍｏｌ）、ヒドロキシルアミン塩酸塩（３．７ｇ，５４ｍｍｏｌ）を加え、加熱還流下３時間撹拌した。その後、水を加え、減圧濃縮によりエタノールを除去し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製することで、表題の化合物（５．１ｇ，２４ｍｍｏｌ）を得た。

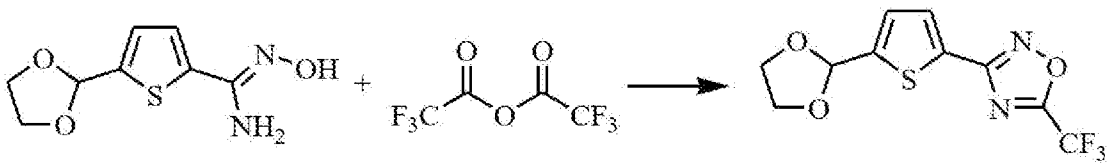
収率：６６％

物性値：融点１３１－１３３℃

[0098] 参考例４

３－［５－（１，３－ジオキソラン－２－イル）チオフェン－２－イル］５－（トリフルオロメチル）－１，２，４－オキサジアゾールの製造

[化8]



（Ｚ）－５－（１，３－ジオキソラン－２－イル）－Ｎ’－ヒドロキシチオフェン－２－カルボキシイミダミド（４．４ｇ，２１ｍｍｏｌ）をクロロホルム（５０ｍＬ）に溶かし、ピリジン（９．７ｇ，１２４ｍｍｏｌ）、トリフルオロ酢酸無水物（８．７ｇ，４１ｍｍｏｌ）を加え、室温で４．５時間攪拌した。その後、水を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製することで、表題の化合物（４．５ｇ，１５ｍｍｏｌ）を得た。

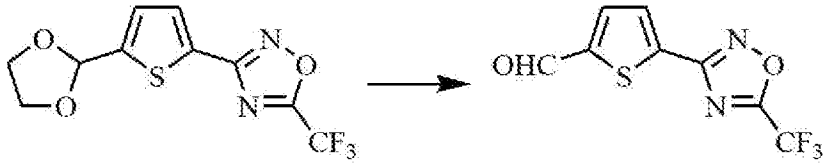
収率：７４％

物性値：融点４４－４５℃

参考例５

５－[５－（トリフルオロメチル）－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル]チオフェン－２－カルボアルデヒドの製造

[化9]



３－［５－（１，３－ジオキソラン－２－イル）チオフェン－２－イル］５－（トリフルオロメチル）－１，２，４－オキサジアゾール（４．４ｇ，１５ｍｍｏｌ）を１，４－ジオキサン４５（ｍＬ）に溶かし、２Ｍ塩酸水溶液（４５ｍｌ，９０ｍｍｏｌ）を加え、室温で４時間攪拌した。その後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮することで、表題の化合物（３．７ｇ，１５ｍｍｏｌ）を得た。

収率：９９％

物性値：融点５６－５７℃

[0099] 以下に、製剤の実施例を示すが、本発明の化合物を含む製剤はこれらに限定されるものではない。製剤例中、部とあるのは重量部を示す。

[0100] 製剤例１．

本発明の一般式（Ｉ）で表される化合物	１０部
キシレン	７０部
Ｎ－メチルピロリドン	１０部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	１０部

以上を均一に混合溶解して乳剤とする。

[0101] 製剤例２．

本発明の一般式（Ｉ）で表される化合物	３部
クレー粉末	８２部
珪藻土粉末	１５部

以上を均一に混合粉砕して粉剤とする。

[0102] 製剤例３．

本発明の一般式（Ｉ）で表される化合物　５部
ベントナイトとクレーの混合粉末　９０部
リグニンスルホン酸カルシウム　５部

以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。

[0103] 製剤例４．

本発明の一般式（Ｉ）で表される化合物　２０部
カオリンと合成高分散珪酸　７５部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと
アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物　５部

以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

[0104] 試験例１．ダイズさび病に対する殺菌効果試験

製剤例１乃至４に準じて調製した本発明の一般式（Ｉ）で表される化合物を有効成分とする薬剤を水で所定濃度に希釈して、径６ｃｍのポットに育苗したダイズ（品種：エンレイ、２葉期）に、１ポット当たり１０ｍｌの割合で茎葉散布した。薬液風乾後、ダイズさび病菌（Phakopsora pachyrhizi）に罹病したダイズ葉から得た胞子から調製した胞子懸濁液を噴霧接種した後、２０℃加湿条件で２４時間保持した後、温室内に移して１０日前後放置した。

評価は各種の発病面積比率を査定し、下記の式１より防除価を算出した。

[数1]

$$\text{防除価（\%）} = \frac{\text{無処理区の平均発病面積比率} - \text{処理区の平均発病比率}}{\text{無処理区の平均発病面積比率}} \times 100$$

判定基準

０　：　防除価が９％以下
１　：　防除価が１０～１９％
２　：　防除価が２０～２９％

３　：　防除価が３０～３９％

４　：　防除価が４０～４９％

５　：　防除価が５０～５９％

６　：　防除価が６０～６９％

７　：　防除価が７０～７９％

８　：　防除価が８０～８９％

９　：　防除価が９０～９９％

１０　：　防除価が１００％

[0105]　上記の試験の結果、本発明の一般式（Ｉ）で表される化合物のうち、１－２、１－３、１－４、１－７及び１－１０は、処理濃度５０ｐｐｍで、判定基準８以上の効果を示した。

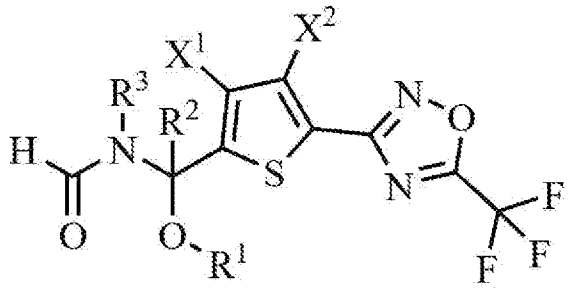
産業上の利用可能性

[0106]　本発明の一般式（Ｉ）で表される化合物又はその塩類は農園芸用殺菌剤として優れた効果を有する。

請求の範囲

[請求項1] 一般式（Ｉ）

[化1]



(I)

{式中、Ｒ^{1}は、

(a1) 水素原子；

(a2) （Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキル基；

(a3) （Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$）アルケニル基；

(a4) （Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$）アルキニル基；

(a5) （Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$）シクロアルキル基；

(a6) ハロ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキル基；

(a7) ハロ（Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$）アルケニル基；

(a8) ハロ（Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$）アルキニル基；又は

(a9) ハロ（Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{8}$）シクロアルキル基を示す。

Ｒ^{2}は、

(b1) 水素原子；

(b2) （Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキル基；

(b3) （Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$）アルケニル基；

(b4) （Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$）アルキニル基；

(b5) （Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$）シクロアルキル基；

(b6) ハロ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$）アルキル基；

(b7) ハロ（Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$）アルケニル基；

(b8) ハロ（Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{6}$）アルキニル基；又は

(b9) ハロ（Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{8}$）シクロアルキル基を示す。

R^3は、

(c1) 水素原子；

(c2) （C_1－C_6）アルキル基；

(c3) （C_2－C_6）アルケニル基；

(c4) （C_2－C_6）アルキニル基；

(c5) （C_3－C_6）シクロアルキル基；

(c6) （C_1－C_6）アルキルカルボニル基；又は

(c7) （C_1－C_6）アルコキシカルボニル基を示す。

X^1及びX^2はそれぞれ独立に、

(e1) 水素原子；

(e2) ハロゲン原子；

(e3) シアノ基；

(e4) ニトロ基；

(e5) （C_1－C_6）アルキル基；

(e6) （C_3－C_6）シクロアルキル基；

(e7) （C_1－C_6）アルコキシ基；

(e8) ハロ（C_1－C_6）アルキル基；

(e9) ハロ（C_1－C_6）アルコキシ基；

(e10) ハロ（C_3－C_6）シクロアルキル基；

(e11) （C_1－C_6）アルキルチオ基；

(e12) （C_1－C_6）アルキルスルフィニル基;

(e13) （C_1－C_6）アルキルスルホニル基;

(e14) ハロ（C_1－C_6）アルキルチオ基；

(e15) ハロ（C_1－C_6）アルキルスルフィニル基;又は

(e16) ハロ（C_1－C_6）アルキルスルホニル基を示す。}

で表される化合物又はその塩類。

[請求項2] R^1が、

(a2) （C_1－C_6）アルキル基；又は

(a5)（C_3－C_6）シクロアルキル基であり、

R^2が、

(b1) 水素原子であり、

R^3が、

(c1) 水素原子であり、

X^1及びX^2が、

(e1) 水素原子である、請求項１に記載の化合物又はその塩類。

[請求項3] R^1が、

(a2)（C_1－C_6）アルキル基である、請求項１又は２に記載の化合物又はその塩類。

[請求項4] 請求項１～３の何れか一項に記載の化合物又はその塩類を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺菌剤。

[請求項5] 請求項４に記載の農園芸用殺菌剤の有効量を植物又は土壌に処理することを特徴とする植物病害の防除方法。

[請求項6] 請求項１～３の何れか一項に記載の化合物又はその塩類の農園芸用殺菌剤としての使用。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2021/043858

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D 413/04(2006.01)i; ***A01P 3/00***(2006.01)i; ***A01N 43/836***(2006.01)i
FI: C07D413/04 CSP; A01N43/836; A01P3/00

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)

C07D413/04; A01P3/00; A01N43/836

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Published examined utility model applications of Japan 1922-1996
Published unexamined utility model applications of Japan 1971-2021
Registered utility model specifications of Japan 1996-2021
Published registered utility model applications of Japan 1994-2021

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAplus/REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, X	WO 2020/256113 A1 (NIHON NOHYAKU CO LTD) 24 December 2020 (2020-12-24) claims, in particular, compound in which R4 is (d1) hydrogen atom	1-6
P, A	WO 2021/090865 A1 (NIHON NOHYAKU CO LTD) 14 May 2021 (2021-05-14) claims, Compound No. 1-39, 1-40, 1-41	1-6
A	WO 2018/117034 A1 (SUMITOMO CHEMICAL CO) 28 June 2018 (2018-06-28) claims, examples	1-6
A	WO 2018/162643 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 13 September 2018 (2018-09-13) claims, examples	1-6
A	WO 2017/085098 A1 (BASF SE) 26 May 2017 (2017-05-26) claims, examples	1-6
A	ROGER, Julien. Palladium-catalysed direct 5-arylation of furfurylamine or 2-(aminoalkyl)-thiophene derivatives. European Journal of Organic Chemistry. 2010, 4412-4425 compound 2e, scheme 1	1-6

☐ 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
24 January 2022	**08 February 2022**
Name and mailing address of the ISA/JP **Japan Patent Office (ISA/JP)** **3-4-3 Kasumigaseki, Chiyoda-ku, Tokyo 100-8915** **Japan**	Authorized officer Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.
PCT/JP2021/043858

Patent document cited in search report	Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)	Publication date (day/month/year)
WO 2020/256113 A1	24 December 2020	(Family: none)	
WO 2021/090865 A1	14 May 2021	(Family: none)	
WO 2018/117034 A1	28 June 2018	JP 2020-23442 A	
WO 2018/162643 A1	13 September 2018	US 2020/0187502 A1 claims, examples	
		JP 2020-514340 A	
		EP 3592738 A1	
		CN 110392683 A	
		BR 112019018651 A	
WO 2017/085098 A1	26 May 2017	CA 3003946 A	
		AR 106762 A	
		AU 2016355949 A	
		CL 2018001348 A	
		KR 10-2018-0083417 A	
		CN 108347937 A	
		MX 2018006235 A	
		EP 3376867 A1	
		CR 20180332 A	
		BR 112018008413 A	
		US 2018/0325114 A1	
		EA 201891153 A	
		JP 2019-502661 A	

国際調査報告

国際出願番号
PCT/JP2021/043858

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（ＩＰＣ））

C07D 413/04(2006.01)i; A01P 3/00(2006.01)i; A01N 43/836(2006.01)i
FI: C07D413/04 CSP; A01N43/836; A01P3/00

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（ＩＰＣ））

C07D413/04; A01P3/00; A01N43/836

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	１９２２－１９９６年
日本国公開実用新案公報	１９７１－２０２１年
日本国実用新案登録公報	１９９６－２０２１年
日本国登録実用新案公報	１９９４－２０２１年

国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）

CAplus/REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献のカテゴリー*	引用文献名　及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する請求項の番号
P, X	WO 2020/256113 A1 (日本農薬株式会社) 24.12.2020 (2020-12-24) 請求の範囲、とくにR4が(d1)水素原子である化合物	1-6
P, A	WO 2021/090865 A1 (日本農薬株式会社) 14.05.2021 (2021-05-14) 請求の範囲、化合物番号1-39、1-40、1-41	1-6
A	WO 2018/117034 A1 (住友化学株式会社) 28.06.2018 (2018-06-28) 請求の範囲、実施例	1-6
A	WO 2018/162643 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG) 13.09.2018 (2018-09-13) 請求の範囲、実施例	1-6
A	WO 2017/085098 A1 (BASF SE) 26.05.2017 (2017-05-26) 請求の範囲、実施例	1-6
A	ROGER, Julien, Palladium-catalysed direct 5-arylation of furfurylamine or 2-(aminoalkyl)-thiophene derivatives, European Journal of Organic Chemistry, 2010, 4412-4425 化合物2e、Scheme 1	1-6

☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☑ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー
"A" 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
"E" 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
"L" 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）
"O" 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
"P" 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献
"T" 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と抵触するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
"X" 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
"Y" 特に関連のある文献であって、当該文献と他の１以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
"&" 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日	国際調査報告の発送日
24.01.2022	08.02.2022

名称及びあて先
日本国特許庁(ISA/JP)
〒100-8915
日本国
東京都千代田区霞が関三丁目４番３号

権限のある職員（特許庁審査官）
東　裕子 4P 9709
電話番号 03-3581-1101 内線 3492

国際調査報告
パテントファミリーに関する情報

国際出願番号
PCT/JP2021/043858

引用文献	公表日	パテントファミリー文献	公表日
WO 2020/256113 A1	24.12.2020	（ファミリーなし）	
WO 2021/090865 A1	14.05.2021	（ファミリーなし）	
WO 2018/117034 A1	28.06.2018	JP 2020-23442 A	
WO 2018/162643 A1	13.09.2018	US 2020/0187502 A1 請求の範囲、実施例 JP 2020-514340 A EP 3592738 A1 CN 110392683 A BR 112019018651 A	
WO 2017/085098 A1	26.05.2017	CA 3003946 A AR 106762 A AU 2016355949 A CL 2018001348 A KR 10-2018-0083417 A CN 108347937 A MX 2018006235 A EP 3376867 A1 CR 20180332 A BR 112018008413 A US 2018/0325114 A1 EA 201891153 A JP 2019-502661 A	