

(19) 日本国特許庁(JP)

## (12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第6633653号  
(P6633653)

(45) 発行日 令和2年1月22日(2020.1.22)

(24) 登録日 令和1年12月20日(2019.12.20)

(51) Int.Cl.

F 1

AO1N 43/56	(2006.01)	AO1N 43/56	C
AO1P 3/00	(2006.01)	AO1P 3/00	
AO1C 1/08	(2006.01)	AO1C 1/08	

請求項の数 9 (全 31 頁)

(21) 出願番号 特願2017-559830 (P2017-559830)  
 (86) (22) 出願日 平成28年5月18日 (2016.5.18)  
 (65) 公表番号 特表2018-515548 (P2018-515548A)  
 (43) 公表日 平成30年6月14日 (2018.6.14)  
 (86) 國際出願番号 PCT/EP2016/061064  
 (87) 國際公開番号 WO2016/184879  
 (87) 國際公開日 平成28年11月24日 (2016.11.24)  
 審査請求日 平成30年11月27日 (2018.11.27)  
 (31) 優先権主張番号 15290131.0  
 (32) 優先日 平成27年5月19日 (2015.5.19)  
 (33) 優先権主張国・地域又は機関  
歐州特許庁 (EP)

(73) 特許権者 507203353  
バイエル・クロップサイエンス・アクチエ  
ンゲゼルシャフト  
ドイツ国、40789・モンハイム・アム  
・ライン、アルフレートーノベルーシュト  
ラーゼ・50  
(74) 代理人 100114188  
弁理士 小野 誠  
(74) 代理人 100119253  
弁理士 金山 賢教  
(74) 代理人 100124855  
弁理士 坪倉 道明  
(74) 代理人 100129713  
弁理士 重森 一輝

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】コーヒーさび病、カンキツ類黒星病、カンキツ類瘡痂病およびバナナブラックシガトカ病の治療方法

## (57) 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

コーヒーさび病、カンキツ類黒星病、カンキツ類瘡痂病またはバナナブラックシガトカ病の防除を必要とする植物の処置方法であつて、前記植物または当該植物の部分、それが成長する元となる種子、またはそれが成長する場所に、その病害防除に有効な量の N - ( 5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル ) - N - シクロプロピル - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドまたは該化合物の農薬として許容される塩を施用することを含む方法。

## 【請求項 2】

前記コーヒーさび病、カンキツ類黒星病、カンキツ類瘡痂病またはバナナブラックシガトカ病が、ヘミレイア ( Hemileia ) 属種、グイグナルディア ( Guignardia ) 属種、エルシノエ ( Elsinoe ) 属種およびマイコスファエレラ ( Mycosphaerella ) 属種から選択される真菌によって引き起こされる請求項 1 に記載の方法。 10

## 【請求項 3】

前記コーヒーさび病、カンキツ類黒星病、カンキツ類瘡痂病またはバナナブラックシガトカ病が、ヘミレイア・バスタトリクス ( Hemileia vastatrix )、グイグナルディア・シトリカルパ ( Guignardia citricarpa )、エルシノエ・ファウセティ ( Elsinoe Fawcettii ) またはマイコスファエレラ・フィジエンシス ( Mycosphaerella fijiensis ) によって引 20

き起こされる、請求項2に記載の方法。

【請求項4】

N - (5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドまたは該化合物の農薬として許容される塩を、前記植物、それが成長する元となる種子、またはそれが成長する場所に、0.001 kg / haから1 kg / haの施用量で施用する、請求項1から3のいずれか1項に記載の方法。

【請求項5】

コーヒーさび病、カンキツ類黒星病、カンキツ類瘡痂病またはバナナブラックシガトカ病を防除するための、N - (5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドまたは該化合物の農薬として許容される塩の使用。

10

【請求項6】

前記コーヒーさび病、カンキツ類黒星病、カンキツ類瘡痂病またはバナナブラックシガトカ病が、ヘミレイア(*Hemileia*)属種、グイグナルディア(*Guignardia*)属種、エルシノエ(*Elsinoe*)属種およびマイコスファエレラ(*Mycosphaerella*)属種から選択される真菌によって引き起こされる請求項5に記載の使用。

【請求項7】

前記コーヒーさび病、カンキツ類黒星病、カンキツ類瘡痂病またはバナナブラックシガトカ病が、ヘミレイア・バスタトリクス(*Hemileia vastatrix*)、グイグナルディア・シトリカルパ(*Guignardia citricarpa*)、エルシノエ・ファウセティ(*Elsinoe Fawcettii*)またはマイコスファエレラ・フィジエンシス(*Mycosphaerella fijiensis*)によって引き起こされる請求項6に記載の使用。

20

【請求項8】

殺虫剤、誘引剤、ダニ駆除剤、殺菌剤(*fungicides*)、殺線虫剤、除草剤、成長調節剤、肥料、薬害軽減剤、植物成熟度に影響する物質および殺菌剤(*bactericides*)からなる群から選択される1以上の有効成分と組み合わせて植物および植物部分に噴霧施用での、請求項5から7のいずれか1項に記載の使用。

30

【請求項9】

遺伝子組み換え品種、その種子、またはこれら品種が成長する耕作地へ施用するための、請求項5から8のいずれか1項に記載の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、コーヒー、かんきつ類およびバナナの植物病原菌の防除のためのN - シクロプロピル - N - [置換されたベンジル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドまたはチオカルボキサミド誘導体および/またはこれらの塩の使用に関する。

40

【背景技術】

【0002】

N - シクロプロピル - N - [置換されたベンジル] - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドまたはチオカルボキサミド誘導体、市販材料からのそれらの製造およびそれらの殺菌剤としての使用が、WO 2007/087906、WO 2009/016220、WO 2010/130767およびEP 2251331に開示されている。これらの化合物は、殺菌剤として用いることができ、他の殺菌剤または殺虫剤と混合することができることも知られている(特許出願PCT/EP2012/001676およびPCT/EP2012/001674参照)。

【0003】

50

それにもかかわらず、前記化合物がコーヒー、かんきつ類およびバナナ、特にコーヒーさび病(coffee rust disease)、カンキツ類黒星病(citrus black spot disease)、カンキツ類瘡痂病(citrus scab disease)およびバナナブラックシガトカ病(banana black sigatoka disease)の主要植物病原菌を大きく防除できることについては、開示も示唆もされていない。

#### 【0004】

真菌ヘミレイア・バスタトリクス(*Hemileia vastatrix*)が原因のコーヒーさび病は、コーヒー植物の最も壊滅的疾病である。コーヒーさび病の症状には、上葉表面上の小さく黄色様油状斑点などがあり、それは拡大してより大きい丸い斑点となり、その斑点は、明橙赤色ないし赤色、そして最終的には黄色境界を有して褐色となる。さび膿疱は葉裏表面上で粉状かつ橙赤色 - 黄色である。その後、膿疱は黒色となる。さび化した葉は落下することで、冒された木は実質的に剥皮する。そのような木は通常、数年以内に枯死する。

#### 【0005】

真菌グイグナルディア・シトリカルパ(*Guingardia citricarpa*)によって引き起こされるカンキツ類黒星病は、果実の量および質の両方の低下の原因となる真菌病である。症状には、果実および葉の両方の病変が含まれ、後者は樹木間の拡散に必須である。

#### 【0006】

エルシノエ・ファウセトイ(*Elsinoe Fawcettii*) (およびそのアナモルフであるスファセロマ・ファウセトイ(*Sphaeloma Fawcettii*))は、かんきつ類の果実、葉および小枝表面に痂皮病変を生じさせる病原体である。*E. Fawcettii*は、多くの異なる各種かんきつ類を冒す。それは、その属における他の種から見て特徴的な形態を有し、かんきつ類が成長する湿潤、熱帯または亜熱帯の気候では経済的に重大である。

#### 【0007】

ブラックシガトカ病は、バナナ斑葉病とも称され、真菌マイコスファエレラ・フィジエンシス(*Mycosphaerella fijiensis*)によって引き起こされるものであり、大きな被害を与え、防除が困難な疾病である。それは、葉面積の大幅な減少、50%以上の収穫損失、および早期成熟を引き起す。

#### 【先行技術文献】

#### 【特許文献】

#### 【0008】

【特許文献1】WO 2007 / 087906

【特許文献2】WO 2009 / 016220

【特許文献3】WO 2010 / 130767

【特許文献4】EP 2251331

【特許文献5】PCT / EP 2012 / 001676

【特許文献6】PCT / EP 2012 / 001674

#### 【発明の概要】

#### 【発明が解決しようとする課題】

#### 【0009】

従って、本発明の目的は、コーヒーさび病、カンキツ類黒星病、カンキツ類瘡痂病またはバナナブラックシガトカ病の防除を高めるさらなる化合物を提供することにあった。

#### 【課題を解決するための手段】

#### 【0010】

従って、本発明は、コーヒーさび病、カンキツ類黒星病、カンキツ類瘡痂病またはバナナブラックシガトカ病を防除するための、下記式(I)を有する化合物またはその農薬として許容される塩の使用を提供する。

10

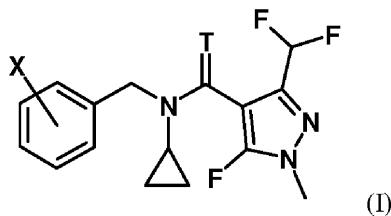
20

30

40

50

## 【化1】



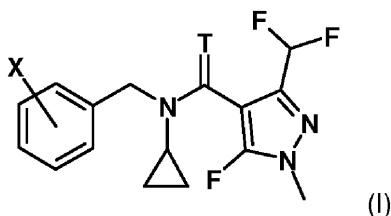
## 【0011】

式中、Tは酸素または硫黄原子を表し、Xは2-イソプロピル、2-シクロプロピル、  
2-tert-ブチル、5-クロロ-2-エチル、5-クロロ-2-イソプロピル、2-エチル-5-フルオロ、5-フルオロ-2-イソプロピル、2-シクロプロピル-5-フルオロ、2-シクロペンチル-5-フルオロ、2-フルオロ-6-イソプロピル、2-エチル-5-メチル、2-イソプロピル-5-メチル、2-シクロプロピル-5-メチル、2-tert-ブチル-5-メチル、5-クロロ-2-(トリフルオロメチル)、5-メチル-2-(トリフルオロメチル)、2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)、3-クロロ-2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)および2-エチル-4,5-ジメチルのリストから選択される。 10

## 【0012】

本発明はさらに、コーヒーさび病、カンキツ類黒星病、カンキツ類瘡痂病またはバナナ  
ブラックシガトカ病の防除を必要とする植物の処置方法であって、当該植物または当該植物  
の部分、例えば葉および果実、その植物が成長する元となる種子またはその植物が成長  
する場所に、その疾患防除に有効な量の式(I)による化合物またはその農薬として許  
容される塩を施用することを含む方法に関するものである。 20

## 【化2】



30

## 【0013】

式中、Tは酸素または硫黄原子を表し、Xは2-イソプロピル、2-シクロプロピル、  
2-tert-ブチル、5-クロロ-2-エチル、5-クロロ-2-イソプロピル、2-エチル-5-フルオロ、5-フルオロ-2-イソプロピル、2-シクロプロピル-5-フルオロ、2-シクロペンチル-5-フルオロ、2-フルオロ-6-イソプロピル、2-エチル-5-メチル、2-イソプロピル-5-メチル、2-シクロプロピル-5-メチル、2-tert-ブチル-5-メチル、5-クロロ-2-(トリフルオロメチル)、5-メチル-2-(トリフルオロメチル)、2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)、3-クロロ-2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)および2-エチル-4,5-ジメチルのリストから選択される。 40

## 【発明を実施するための形態】

## 【0014】

本発明の文脈において、コーヒーは、コーヒー属、特に熱帯コーヒー属、特別にはC.  
アラビカ(C. Arabica)またはC. カネホラ(C. canephora)の木  
または低木を意味する。

## 【0015】

本発明の文脈において、かんきつ類は、ミカン科かんきつ類属の全ての木または低木特  
に熱帯性および亜熱帯性のを意味する。それには特に、オレンジ、レモン、ライム、グレ 50

ープフルーツ、カラモンジンなどがある。

【0016】

本発明の文脈において、バナナは、バショウ科バショウ属の草本木様植物、特には熱帶性および亜熱帶性のもの、特別にはM. sapientum (M. sapientum) を意味する。

【0017】

本発明の使用および方法の特定の実施形態において、コーヒーさび病は、ヘミレイア (Hemileia) 属種からの真菌、特にはヘミレイア・バスタトリクス (Hemileia vastatrix) によって引き起こされる。

【0018】

本発明の使用および方法の特定の実施形態において、カンキツ黒星サビ病は、グイグナルディア (Guignardia) 属種からの真菌、特にはグイグナルディア・シトリカルパ (Guignardia citricarpa) によって引き起こされる。

【0019】

本発明の使用および方法の特定の実施形態において、カンキツ類瘡痂病は、エルシノエ (Elinoe) 属種からの真菌、特にはエルシノエ・ファウセティ (Elinoe Fawcettii) によって引き起こされる。

【0020】

本発明の使用および方法の特定の実施形態において、バナナブラックシガトカ病は、マイコスファエレラ (Mycosphaerella) 属種からの真菌、特にはマイコスファエレラ・フィジエンシス (Mycosphaerella fijiensis) によって引き起こされる。

【0021】

好ましいものは、式(I)の化合物が、  
N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物A1)、  
N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物A2)、  
N - (2 - tert - ブチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物A3)、  
N - (5 - クロロ - 2 - エチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物A4)、  
N - (5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物A5)、  
N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - フルオロベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物A6)、  
N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (5 - フルオロ - 2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物A7)、  
N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - フルオロベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物A8)、  
N - (2 - シクロペンチル - 5 - フルオロベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (化合物A9)、

10

20

30

40

50

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - フルオロ - 6 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド(化合物 A 10)、

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 5 - メチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド(化合物 A 11)、

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピル - 5 - メチルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド(化合物 A 12)、

N - シクロプロピル - N - (2 - シクロプロピル - 5 - メチルベンジル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド(化合物 A 13)、

N - (2 - t e r t - ブチル - 5 - メチルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド(化合物 A 14)、

N - [5 - クロロ - 2 - (トリフルオロメチル)ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド(化合物 A 15)、

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - N - [5 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル)ベンジル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド(化合物 A 16)、

N - [2 - クロロ - 6 - (トリフルオロメチル)ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド(化合物 A 17)、

N - [3 - クロロ - 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル)ベンジル] - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド(化合物 A 18)。

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - N - (2 - エチル - 4 , 5 - ジメチルベンジル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド(化合物 A 19)、

および

N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - N - (2 - イソプロピルベンジル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボチオアミド(化合物 A 20)、

またはその農薬として許容される塩からなる群から選択される本発明による使用および方法である。

#### 【0022】

より好ましい式(I)の化合物は、N - (5 - クロロ - 2 - イソプロピルベンジル) - N - シクロプロピル - 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド(化合物 A 5)である。

#### 【0023】

従って本発明は、少なくとも一つの本明細書で定義の式(I)の化合物もしくはその塩、または本明細書で定義の式(I)の化合物もしくはその塩の下記の定義による農薬有効成分とのいずれか所望の混合物の使用、ならびにコーヒーさび病、カンキツ類黒星病、カンキツ類瘡痂病もしくはバナナブラックシガトカ病の防除を促進するための前記化合物、混合物または塩の使用方法を提供する。

#### 【0024】

本発明はさらに、コーヒーさび病、カンキツ類黒星病、カンキツ類瘡痂病またはバナナブラックシガトカ病の防除に有効な量の少なくとも一つの本明細書で定義の式(I)の化合物もしくはその塩を含む、植物の処理のための含む溶液を提供する。

10

20

30

40

50

## 【0025】

1 実施形態において、例えば、少なくとも一つの本明細書で定義の式(Ⅰ)の化合物またはその塩を、適切な植物または処理されるべき植物部分に噴霧施用することで施用することが可能である。本発明に従って想到される少なくとも一つの本明細書で定義の式(Ⅰ)の化合物またはその塩の使用は、好ましくは0.0005から3kg/ha、より好ましくは0.001から2kg/ha、特別に好ましくは0.001から1kg/haの用量で行う。本発明の文脈において、アブシジン酸を、少なくとも一つの本明細書で定義の式(Ⅰ)の化合物またはその塩と同時に、例えば共同調製物または製剤の文脈で使用する場合、アブシジン酸を、好ましくは0.001から3kg/ha、より好ましくは0.001から2kg/ha、特別に好ましくは0.001から1kg/haの用量で加える。10

## 【0026】

より詳細には、本発明の使用および方法は、植物および植物部分への噴霧施用で記載の利点を示す。少なくとも一つの本明細書で定義の式(Ⅰ)の化合物またはその塩と殺虫剤、誘引剤、ダニ駆除剤、殺菌剤、殺線虫剤、除草剤、成長調節剤、薬害軽減剤、肥料、植物成熟度に影響する物質、および殺菌剤などの物質との組み合わせも同様に、本発明の文脈で植物障害の防除で用いることができる。さらに、コーヒーさび病、カンキツ類黒星病、カンキツ類瘡痂病またはバナナブラックシガトカ病の防除上昇を目的とする、少なくとも一つの本明細書で定義の式(Ⅰ)の化合物またはその塩と遺伝子組み換え品種との併用も同様に可能である。20

## 【0027】

本発明による化合物を用いることができる組み合わせでの殺菌剤の下記リストは、可能な組み合わせを示すためのものであって、限定を加えるものではない。

## 【0028】

本明細書中において、一般名によって特定されている有効成分は既知であり、そして、例えば、The Pesticide Manual (16th Ed., British Crop Protection Council)に記載されているか、インターネットで検索することができる(例えば、www.alanwood.net/pesticides)。

## 【0029】

化合物(A)または化合物(B)が互変異体で存在することができる場合、そのような化合物は、上記および下記で、適用可能な場合、各場合で具体的に言及されていない場合であっても、相当する互変異型を含むことも理解される。30

## 【0030】

群(1)から(15)の全ての挙げられた混合相手は、それらの官能基によって可能であれば、好適な塩基または酸と塩を形成しても良い。

## 【0031】

1) エルゴステロール生合成の阻害薬、例えば、(1.001)アルジモルフ、(1.002)アザコナゾール、(1.003)ビテルタノール、(1.004)プロムコナゾール、(1.005)シプロコナゾール、(1.006)ジクロブトラゾール、(1.007)ジフェノコナゾール、(1.008)ジニコナゾール、(1.009)ジニコナゾール-M、(1.010)ドデモルフ、(1.011)酢酸ドデモルフ、(1.012)エポキシコナゾール、(1.013)エタコナゾール、(1.014)フェナリモール、(1.015)フェンブコナゾール、(1.016)フェンヘキサミド、(1.017)フェンプロピジン、(1.018)フェンプロピモルフ、(1.019)フルキンコナゾール、(1.020)フルルプリミドール、(1.021)フルシラゾール、(1.022)フルトリニアホール、(1.023)フルコナゾール、(1.024)フルコナゾール-シス、(1.025)ヘキサコナゾール、(1.026)イマザリル、(1.027)硫酸イマザリル、(1.028)イミベンコナゾール、(1.029)イプコナゾール、(1.030)メトコナゾール、(1.031)ミクロブタニル、(1.032)ナフチ4050

フィン、(1.033)ヌアリモール、(1.034)オキシポコナゾール、(1.035)パクロブトラゾール、(1.036)ペフラゾエート、(1.037)ベンコナゾール、(1.038)ピペラリン、(1.039)プロクロラズ、(1.040)プロピコナゾール、(1.041)プロチオコナゾール、(1.042)ピリブチカルブ、(1.043)ピリフェノックス、(1.044)キンコナゾール、(1.045)シメコナゾール、(1.046)スピロキサミン、(1.047)テブコナゾール、(1.048)テルビナフィン、(1.049)テトラコナゾール、(1.050)トリアジメホン、(1.051)トリアジメノール、(1.052)トリデモルフ、(1.053)トリフルミゾール、(1.054)トリホリン、(1.055)トリチコナゾール、(1.056)ウニコナゾール、(1.057)ウニコナゾール-P、(1.058)ビニコナゾール、(1.059)ボリコナゾール、(1.060)1-(4-クロロフェニル)-2-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)シクロヘプタノール、(1.061)1-(2,2-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-1H-イミダゾール-5-カルボン酸メチル、(1.062)N-{5-(ジフルオロメチル)-2-メチル-4-[3-(トリメチルシリル)プロポキシ]フェニル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1.063)N-エチル-N-メチル-N-{2-メチル-5-(トリフルオロメチル)-4-[3-(トリメチルシリル)プロポキシ]フェニル}イミドホルムアミド、および(1.064)O-[1-(4-メトキシフェノキシ)-3,3-ジメチルブタン-2-イル]-1H-イミダゾール-1-カルボチオエート、(1.065)ピリソキサゾール、(1.066)2-{[3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-チオン、(1.067)1-{[3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イルチオシアネット、(1.068)5-(アリルスルファニル)-1-{[3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1,2,4-トリアゾール、(1.069)2-[1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2,6,6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-チオン、(1.070)2-[rel(2R,3S)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-5-イルチオシアネット、(1.071)2-[rel(2R,3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-チオン、(1.072)1-{[rel(2R,3S)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イルチオシアネット、(1.073)1-{[rel(2R,3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イルチオシアネット、(1.074)5-(アリルスルファニル)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1,2,4-トリアゾール、(1.075)5-(アリルスルファニル)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)オキシラン-2-イル]メチル}-1H-1,2,4-トリアゾール、(1.076)2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2,6,6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-チオン、(1.077)2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2,6,6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-チオン、(1.078)2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2,6,6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,

10

20

30

40

50

4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.079) 2 - [ (2S, 4R, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.080) 2 - [ (2S, 4S, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.081) 2 - [ (2R, 4S, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.082) 2 - [ (2R, 4R, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.083) 2 - [ (2S, 4R, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.084) 2 - [ 4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)プロパン - 2 - オール、(1.085) 2 - [ 4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)ブタン - 2 - オール、(1.086) 2 - [ 4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)ペンタン - 2 - オール、(1.087) 2 - [ 2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ)フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)ブタン - 2 - オール、(1.088) 2 - [ 2 - クロロ - 4 - (2, 4 - ジクロロフェノキシ)フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)プロパン - 2 - オール、(1.089) (2R) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1R) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)ブタン - 2 - オール、(1.090) (2R) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1S) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)ブタン - 2 - オール、(1.091) (2S) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1S) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)ブタン - 2 - オール、(1.092) (2S) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1R) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)ブタン - 2 - オール、(1.093) (1S, 2R, 5R) - 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル)シクロペタノール、(1.094) (1R, 2S, 5S) - 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル)シクロペタノール、(1.095) 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル)シクロペタノール、(1.096) (2R) - 2 - [ 4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)プロパン - 2 - オール、(1.097) (2S) - 2 - [ 4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル)プロパン - 2 - オール、(1.098) 1 - ({(2R, 4S) - 2 - [ 2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ)フェニル] - 4 - メチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル}メチル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.099) 1 - ({(2S, 4S) - 2 - [ 2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ)フェニル] - 4 - メチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル}メチル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.100) フエンピラザミン、(1.101) N - (4 - {[ 3 - (4 - クロロベンジル) - 1, 2, 4 - チアジアゾール - 5 - イル]オキシ}) - 2, 5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.102) N - {4 - [(3 - tert - ブチル - 4 - シアノ - 1, 2 - チアゾール - 5 - イル)オキシ] - 2 - クロロ 10

20

30

40

50

- 5 - メチルフェニル} - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.103)  
 [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2,4 - ジフルオロフェニル) -  
 1,2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(1.104)  
 (S) - [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2,4 - ジフルオロフェ  
 ニル) - 1,2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(1.  
 105) (R) - [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2,4 - ジフル  
 オロフェニル) - 1,2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール  
 、(1.106) N - [5 - プロモ - 6 - (2,3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 2 -  
 イルオキシ) - 2 - メチルピリジン - 3 - イル] - N - エチル - N - メチルイミドホルム  
 アミド、(1.107) N - {5 - プロモ - 6 - [1 - (3,5 - ジフルオロフェニル  
 )エトキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチルイミドホルム  
 アミド、(1.108) N - {5 - プロモ - 6 - [(1R) - 1 - (3,5 - ジフルオ  
 ロフェニル)エトキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N - メチルイ  
 ミドホルムアミド、(1.109) N - {5 - プロモ - 6 - [(1S) - 1 - (3,5  
 - ジフルオロフェニル)エトキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル - N  
 -  
 メチルイミドホルムアミド、(1.110) N - {5 - プロモ - 6 - [(シス - 4 - イ  
 ソプロピルシクロヘキシル)オキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N - エチル -  
 N - メチルイミドホルムアミド、(1.111) N - {5 - プロモ - 6 - [(トランス  
 - 4 - イソプロピルシクロヘキシル)オキシ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル} - N -  
 20  
 エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.112) N - (2,5 - ジメチル - 4  
 - フェノキシフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.113)  
 N - {4 - [(4,5 - ジクロロ - 1,3 - チアゾール - 2 - イル)オキシ] - 2,5  
 - ジメチルフェニル} - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.114) N  
 - (4 - {3 - [(ジフルオロメチル)スルファニル]フェノキシ} - 2,5 - ジメチ  
 ルフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.115) N - (2  
 ,5 - ジメチル - 4 - {3 - [(1,1,2,2 - テトラフルオロエチル)スルファニル  
 ]フェノキシ}フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.116  
 ) N - (2,5 - ジメチル - 4 - {3 - [(2,2,2 - トリフルオロエチル)スルフ  
 アニル]フェノキシ}フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.  
 31  
 117) N - (2,5 - ジメチル - 4 - {3 - [(2,2,3,3 - テトラフルオロブ  
 ロピル)スルファニル]フェノキシ}フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルム  
 アミド、(1.118) N - (2,5 - ジメチル - 4 - {3 - [(ペンタフルオロエチ  
 尔)スルファニル]フェノキシ}フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミ  
 ド、(1.119) N - (4 - {[3 - (ジフルオロメトキシ)フェニル]スルファニ  
 尔} - 2,5 - ジメチルフェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、(1.  
 120) N - (2,5 - ジメチル - 4 - {[3 - (1,1,2,2 - テトラフルオロ  
 エトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル) - N - エチル - N - メチルイミドホルム  
 アミド、(1.121) N - (2,5 - ジメチル - 4 - {[3 - (2,2,2 - トリフ  
 ルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル) - N - エチル - N - メチルイ  
 ミドホルムアミド、(1.122) N - (2,5 - ジメチル - 4 - {[3 - (2,2,3,  
 3 - テトラフルオロプロポキシ)フェニル]スルファニル}フェニル) - N - エチル - N  
 - メチルイミドホルムアミド、(1.123) N - (2,5 - ジメチル - 4 - {[3 -  
 (ペンタフルオロエトキシ)フェニル]スルファニル}フェニル) - N - エチル - N - メ  
 チルイミドホルムアミド。  
 40  
 【0032】  
 2) 複合体IまたはIIでの呼吸鎖の阻害薬、例えば、(2.001)ビキサafen、  
 (2.002)ボスカリド、(2.003)カルボキシン、(2.004)ジフルメトリ  
 ム、(2.005)フェンフラム、(2.006)フルオピラム、(2.007)フルト  
 ラニル、(2.008)フルキサピロキサド、(2.009)フラメトピル、(2.01  
 50

0 ) フルメシクロックス、( 2 . 0 1 1 ) イソピラザム(シン - エピマー性ラセミ化合物  
 ( 1 R S , 4 S R , 9 R S )とアンチ - エピマー性ラセミ体( 1 R S , 4 S R , 9 S R )  
 の混合物)、( 2 . 0 1 2 ) イソピラザム(アンチ - エピマー性ラセミ体 1 R S , 4 S R  
 , 9 S R )、( 2 . 0 1 3 ) イソピラザム(アンチ - エピマー性エナンチオマー 1 R , 4 S , 9 S )、( 2 . 0 1 4 ) イソピラザム(アンチ - エピマー性エナンチオマー 1 S , 4 R , 9 R )、( 2 . 0 1 5 ) イソピラザム(シン - エピマー性ラセミ化合物 1 R S , 4 S R , 9 R S )、( 2 . 0 1 6 ) イソピラザム(シン - エピマー性エナンチオマー 1 R , 4 S , 9 R )、( 2 . 0 1 7 ) イソピラザム(シン - エピマー性エナンチオマー 1 S , 4 R , 9 S )、( 2 . 0 1 8 ) メプロニル、( 2 . 0 1 9 ) オキシカルボキシン、( 2 . 0 2 0 ) ペンフルフェン、( 2 . 0 2 1 ) ペンチオピラド、( 2 . 0 2 2 ) セダキサン、( 2 . 0 2 3 ) チフルザミド、( 2 . 0 2 4 ) 1 - メチル - N - [ 2 - ( 1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ ) フェニル ] - 3 - ( トリフルオロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 2 5 ) 3 - ( ジフルオロメチル ) - 1 - メチル - N - [ 2 - ( 1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ ) フェニル ] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 2 6 ) 3 - ( ジフルオロメチル ) - N - [ 4 - フルオロ - 2 - ( 1 , 1 , 2 , 3 , 3 , 3 - ヘキサフルオロプロポキシ ) フェニル ] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 2 7 ) N - [ 1 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 1 - メトキシプロパン - 2 - イル ] - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 2 8 ) 5 , 8 - ジフルオロ - N - [ 2 - ( 2 - フルオロ - 4 - { [ 4 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 2 - イル ] オキシ } フェニル ) エチル ] キナゾリン - 4 - アミン、( 2 . 0 2 9 ) ベンゾビンジフルピル、( 2 . 0 3 0 ) N - [ ( 1 S , 4 R ) - 9 - ( ジクロロメチレン ) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノナフタレン - 5 - イル ] - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 3 1 ) N - [ ( 1 R , 4 S ) - 9 - ( ジクロロメチレン ) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノナフタレン - 5 - イル ] - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 3 2 ) 3 - ( ジフルオロメチル ) - 1 - メチル - N - ( 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 3 3 ) 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - ( 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 3 4 ) 1 - メチル - 3 - ( トリフルオロメチル ) - N - ( 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 3 5 ) 1 - メチル - 3 - ( トリフルオロメチル ) - N - [ ( 3 R ) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 3 6 ) 1 - メチル - 3 - ( トリフルオロメチル ) - N - [ ( 3 S ) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 3 7 ) 3 - ( ジフルオロメチル ) - 1 - メチル - N - [ ( 3 S ) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 3 8 ) 3 - ( ジフルオロメチル ) - 1 - メチル - N - [ ( 3 R ) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 3 9 ) 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - [ ( 3 R ) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 4 0 ) 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - [ ( 3 S ) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 4 1 ) ベノダニル、( 2 . 0 4 2 ) 2 - クロロ - N - ( 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド、( 2 . 0 4 3 ) イソフェタミド、( 2 . 0 4 4 ) 1 - メチル - 3 - ( トリフルオロメチル ) - N - [ 2 - ( トリフルオロメチル ) ビフェニル - 2 - イル ] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 4 5 ) N - ( 4 - クロロビフェニル - 2 - イル ) - 3

10

20

30

40

50

- (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.046) N - (2, 4 - ジクロロビフェニル - 2 - イル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.047) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [4 - (トリフルオロメチル) ビフェニル - 2 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.048) N - (2, 5 - ジフルオロビフェニル - 2 - イル) - 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.049) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [4 - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.050) 5 - フルオロ - 1, 3 - ジメチル - N - [4 - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.051) 2 - クロロ - N - [4 - (プロパ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] ニコチンアミド、(2.052) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4 - (3, 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.053) N - [4 - (3, 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 5 - フルオロ - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.054) 3 - (ジフルオロメチル) - N - (4 - エチニルビフェニル - 2 - イル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.055) N - (4 - エチニルビフェニル - 2 - イル) - 5 - フルオロ - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.056) 2 - クロロ - N - (4 - エチニルビフェニル - 2 - イル) ニコチンアミド、(2.057) 2 - クロロ - N - [4 - (3, 3 - ジメチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] ニコチンアミド、(2.058) 4 - (ジフルオロメチル) - 2 - メチル - N - [4 - (トリフルオロメチル) ビフェニル - 2 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 5 - カルボキサミド、(2.059) 5 - フルオロ - N - [4 - (3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.060) 2 - クロロ - N - [4 - (3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] ニコチンアミド、(2.061) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4 - (3 - メトキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.062) 5 - フルオロ - N - [4 - (3 - メトキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.063) 2 - クロロ - N - [4 - (3 - メトキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] ニコチンアミド、(2.064) 1, 3 - ジメチル - N - (1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.065) 1, 3 - ジメチル - N - [(3R) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.066) 1, 3 - ジメチル - N - [(3S) - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.067) 3 - (ジフルオロメチル) - N - メトキシ - 1 - メチル - N - [1 - (2, 4, 6 - ト 40 リクロロフェニル) プロパン - 2 - イル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.068) 3 - (ジフルオロメチル) - N - (7 - フルオロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.069) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [(3R) - 7 - フルオロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.070) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [(3S) - 7 - フルオロ - 1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、(2.071) ピラジフルミド、(2.072) 2 - フルオロ - 6 - (トリフルオロメチル) - N - (1, 1, 3 - トリメチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル) ベ 50

ンズアミド、(2.073)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.074)N-シクロプロピル-N-(2-シクロプロピルベンジル)-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.075)N-(2-tert-ブチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.076)N-(5-クロロ-2-エチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.077)N-(5-クロロ-2-イソプロピルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.078)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-N-(2-エチル-5-フルオロベンジル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.079)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.080)N-シクロプロピル-N-(2-シクロプロピル-5-フルオロベンジル)-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.081)N-(2-シクロペンチル-5-フルオロベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.082)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-フルオロ-6-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.083)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-N-(2-エチル-5-メチルベンジル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.084)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-

-N-(2-イソプロピル-5-メチルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.085)N-シクロプロピル-N-(2-シクロプロピル-5-メチルベンジル)-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.086)N-(2-tert-ブチル-5-メチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.087)N-[5-クロロ-2-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.088)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-N-[5-メチル-2-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.089)N-[2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.090)N-[3-クロロ-2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.091)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-N-(2-エチル-4,5-ジメチルベンジル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.092)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボチオアミド。

### 【0033】

3) 複合体IIIでの呼吸鎖の阻害薬、例えば、(3.001)アメトクトラジン、(3.002)アミスルブロム、(3.003)アゾキシストロビン、(3.004)シアゾファミド、(3.005)クメトキシストロビン(coumethoxystrobin)、(3.006)クモキシストロビン、(3.005)ジモキシストロビン、(3.008)エノキサストロビン、(3.009)ファモキサドン、(3.010)フェンア

ミドン、(3.011)フルフェノキシストロビン(flufenoxystrobin)、(3.012)フルオキサストロビン、(3.013)クレソキシム-メチル、(3.014)メトミノストロビン、(3.015)オリサストロビン、(3.016)ピコキシストロビン、(3.017)ピラクロストロビン、(3.018)ピラメトストロビン、(3.019)ピラオキシストロビン、(3.020)ピリベンカルブ、(3.021)トリクロピリカルブ、(3.022)トリフロキシストロビン、(3.023)(2E)-2-(2-{[6-(3-クロロ-2-メチルフェノキシ)-5-フルオロピリミジン-4-イル]オキシ}フェニル)-2-(メトキシイミノ)-N-メチルアセトアミド、(3.024)(2E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-{[(1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン}アミノ)オキシ]メチル}フェニル)アセトアミド、(3.025)(2E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-{2-[{(E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エトキシ}イミノ)メチル]フェニル}エタンアミド、(3.026)(2E)-2-{2-[{(1E)-1-[3-{[(E)-1-フルオロ-2-フェニルビニル]オキシ}フェニル]エチリデン}アミノ}オキシ)メチル]フェニル}-2-(メトキシイミノ)-N-メチルアセトアミド、(3.027)フェナミノストロビン(fenamino strobin)、(3.028)5-メトキシ-2-メチル-4-(2-{[(1E)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチルデン}アミノ)オキシ]メチル}フェニル)-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン、(3.029)(2E)-2-{2-[{(シクロプロピル[(4-メトキシフェニル)イミノ]メチル}スルファニル)メチル]フェニル}-3-メトキシアクリル酸メチル、(3.030)N-(3-エチル-3,5,5-トリメチルシクロヘキシル)-3-ホルムアミド-2-ヒドロキシベンズアミド、(3.031)2-{2-[{(2,5-ジメチルフェノキシ)メチル]フェニル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド、(3.032)2-{2-[{(2,5-ジメチルフェノキシ)メチル]フェニル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド、(3.033)(2E,3Z)-5-{[1-(4-クロロフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル]オキシ}-2-(メトキシイミノ)-N,3-ジメチルペンタ-3-エンアミド、(3.034)(2S)-2-{2-[{(2,5-ジメチルフェノキシ)メチル]フェニル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド、(3.035)(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[{(3-[{(イソブチリルオキシ)メトキシ]-4-メトキシピリジン-2-イル}カルボニル)アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル2-メチルプロパンエート。

#### 【0034】

4) 有糸分裂および細胞分裂の阻害薬、例えば、(4.001)ベノミル、(4.002)カルベンダジム、(4.003)クロルフェナゾール、(4.004)ジエトフェンカルブ、(4.005)エタボキサム、(4.006)フルオピコリド、(4.007)フベリダゾール、(4.008)ベンシクロン、(4.009)チアベンダゾール、(4.010)チオファネート-メチル、(4.011)チオファネート、(4.012)ゾキサミド、(4.013)5-クロロ-7-(4-メチルピベリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン、(4.014)3-クロロ-5-(6-クロロピリジン-3-イル)-6-メチル-4-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリダジン、(4.015)3-クロロ-5-(4-クロロフェニル)-4-(2,6-ジフルオロフェニル)-6-メチルピリダジン、(4.016)4-(4-クロロフェニル)-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-3,6-ジメチルピリダジン、(4.017)N-[{(5-プロモ-3-クロロピリジン-2-イル)メチル]-2,4-ジクロロニコチンアミド、(4.018)N-[1-(5-プロモ-3-クロロピリジン-2-イル)エチル]-2,4-ジクロロニコチンアミド、(4.019)N-[1-(5-プロモ-3-クロロピリジン-2-イル)エチル]-2-フルオロ-4-ヨードニコチンアミド、(4.020)N-[4-クロロ-2-

10

20

30

40

50

, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 1 ) 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - ( 2 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 2 ) 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 3 ) 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - ( 2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 4 ) 4 - ( 2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - ( 2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 5 ) N - ( 2 - ブロモ - 6 - フルオロフェニル) - 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 6 ) 4 - ( 2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - ( 2 - ブロモ - 6 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 7 ) 4 - ( 2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - ( 2 - ブロモ - 6 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 8 ) 4 - ( 2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - ( 2 - クロロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 9 ) N - ( 2 - ブロモフェニル) - 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 3 0 ) 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - ( 2 - クロロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 3 1 ) 4 - ( 2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 3 2 ) 4 - ( 2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - ( 2 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 3 3 ) 3 - クロロ - 4 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 6 - メチル - 5 - フェニルピリダジン。 10

## 【0035】

5 ) 多部位作用を有することができる化合物、例えば、( 5 . 0 0 1 ) ボルドー液、( 5 . 0 0 2 ) カプタホール、( 5 . 0 0 3 ) キャプタン、( 5 . 0 0 4 ) クロロタロニル、( 5 . 0 0 5 ) 水酸化銅、( 5 . 0 0 6 ) ナフテン酸銅、( 5 . 0 0 7 ) 酸化銅、( 5 . 0 0 8 ) 塩基性塩化銅、( 5 . 0 0 9 ) 硫酸銅( 2 + )、( 5 . 0 1 0 ) ジクロフルアニド、( 5 . 0 1 1 ) ジチアノン、( 5 . 0 1 2 ) ドジン、( 5 . 0 1 3 ) ドジン遊離塩基、( 5 . 0 1 4 ) ファーバム、( 5 . 0 1 5 ) フルオロホルペット、( 5 . 0 1 6 ) ホルペット、( 5 . 0 1 7 ) グアザチン、( 5 . 0 1 8 ) 酢酸グアザチン、( 5 . 0 1 9 ) イミノクタジン、( 5 . 0 2 0 ) イミノクタジンアルベシル酸塩、( 5 . 0 2 1 ) イミノクタジン三酢酸塩、( 5 . 0 2 2 ) マンカッパー、( 5 . 0 2 3 ) マンゼブ、( 5 . 0 2 4 ) マンネブ、( 5 . 0 2 5 ) メチラム、( 5 . 0 2 6 ) メチラム亜鉛、( 5 . 0 2 7 ) オキシン - 銅( o x i n e - c o p p e r )、( 5 . 0 2 8 ) プロパミジン( p r o p a m i d i n e )、( 5 . 0 2 9 ) プロピネブ、( 5 . 0 3 0 ) 硫黄および硫黄剤、例えば多硫化カルシウム、( 5 . 0 3 1 ) チウラム、( 5 . 0 3 2 ) トリルフルアニド、( 5 . 0 3 3 ) ジネブ、( 5 . 0 3 4 ) ジラム、( 5 . 0 3 5 ) アニラジン。 30

## 【0036】

6 ) 宿主防可能な化合物、例えば、( 6 . 0 0 1 ) アシベンゾラル - S - メチル、( 6 . 0 0 2 ) イソチアニル、( 6 . 0 0 3 ) プロベナゾール、( 6 . 0 0 4 ) チアジニル、( 6 . 0 0 5 ) ラミナリン( l a m i n a r i n )。 40

## 【0037】

7 ) アミノ酸および / またはタンパク質の生合成の阻害薬、例えば、( 7 . 0 0 1 ) アンドプリム( a n d o p r i m )、( 7 . 0 0 2 ) ブラストサイジン - S 、( 7 . 0 0 3 ) シプロジニル、( 7 . 0 0 4 ) カスガマイシン、( 7 . 0 0 5 ) カスガマイシン塩酸塩水和物、( 7 . 0 0 6 ) メパニピリム、( 7 . 0 0 7 ) ピリメタニル、( 7 . 0 0 8 ) 3 - ( 5 - フルオロ - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル ) キノリン、( 7 . 0 0 9 ) オキシテトラサイクリン、( 7 . 0 1 0 ) ストレプト 50

マイシン。

**【0038】**

8) ATP産生の阻害薬、例えば、(8.001)酢酸トリフェニルスズ、(8.002)塩化トリフェニルスズ、(8.003)水酸化トリフェニルスズ、(8.004)シリチオファム。

**【0039】**

9) 細胞壁合成の阻害薬、例えば、(9.001)ベンチアバリカルブ、(9.002)ジメトモルフ、(9.003)フルモルフ、(9.004)イプロバリカルブ、(9.005)マンジプロパミド、(9.006)ポリオキシン、(9.007)ポリオキソリム、(9.008)バリダマイシン、(9.009)バリフェナレート、(9.010)ポリオキシンB、(9.011)(2E)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル)プロパ-2-エン-1-オン、(9.012)(2Z)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル)プロパ-2-エン-1-オン、(9.013)ピリモルフ。

**【0040】**

10) 脂質および膜の合成の阻害薬、例えば、(10.001)ビフェニル、(10.002)クロロネブ、(10.003)ジクロラン、(10.004)エジフェンホス、(10.005)エトリジアゾール、(10.006)ヨードカルブ(iodoocarb)、(10.007)イプロベンホス、(10.008)イソプロチオラン、(10.009)プロパモカルブ、(10.010)プロパモカルブ塩酸塩、(10.011)プロチオカルブ、(10.012)ピラゾホス、(10.013)キントゼン、(10.014)テクナゼン、(10.015)トルクロホス-メチル。

**【0041】**

11) メラニン生合成の阻害薬、例えば、(11.001)カルプロパミド、(11.002)ジクロシメット、(11.003)フェノキサニル、(11.004)フタリド、(11.005)ピロキロン、(11.006)トリシクラゾール、(11.007){3-メチル-1-[4-メチルベンゾイル]アミノ}ブタン-2-イルカルバミン酸2,2,2-トリフルオロエチル。

**【0042】**

12) 核酸合成の阻害薬、例えば、(12.001)ベナラキシル、(12.002)ベナラキシル-M(キララキシル(kirala xyl))、(12.003)ブピリメート、(12.004)クロジラコン、(12.005)ジメチリモール、(12.006)エチリモール、(12.007)フララキシル、(12.008)ヒメキサゾール、(12.009)メタラキシル、(12.010)メタラキシル-M(メフェノキサム)、(12.011)オフラセ、(12.012)オキサジキシル、(12.013)オキソリン酸、(12.014)オクチリノン。

**【0043】**

13) シグナル伝達の阻害薬、例えば、(13.001)クロゾリネート、(13.002)フェンピクロニル、(13.003)フルジオキソニル、(13.004)イプロジオン、(13.005)プロシミドン、(13.006)キノキシフェン、(13.007)ピンクロゾリン、(13.008)プロキナジド。

**【0044】**

14) アンカプラーとして作用し得る化合物、例えば、(14.001)ビナパクリル、(14.002)ジノカップ、(14.003)フェリムゾン、(14.004)フルアジナム、(14.005)メプチルジノカップ。

**【0045】**

15) さらなる化合物、例えば、(15.001)ベンチアゾール、(15.002)ペトキサジン、(15.003)カプシマイシン(capsimycin)、(15.004)カルボン、(15.005)キノメチオネット、(15.006)ピリオフェノン。

(クラザフェノン (ch1azafenone))、(15.007)クフラネブ、(15.008)シフルフェナミド、(15.009)シモキサニル、(15.010)シプロスルファミド、(15.011)ダゾメット、(15.012)デバカルブ、(15.013)ジクロロフエン、(15.014)ジクロメジン、(15.015)ジフェンゾコート、(15.016)ジフェンゾコートメチル硫酸塩、(15.017)ジフェニルアミン、(15.018)エコメイト、(15.019)フルメトベル、(15.020)フルオルイミド、(15.021)フルスルファミド、(15.022)フルチアニル、(15.023)ホセチル-アルミニウム、(15.024)ホセチル-カルシウム、(15.025)ホセチル-ナトリウム、(15.026)ヘキサクロロベンゼン、(15.027)イルママイシン、(15.028)メタスルホカルブ、(15.029)イソチオシアノ酸メチル、(15.030)メトラフェノン、(15.031)ミルディオマイシン、(15.032)ナタマイシン、(15.033)ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、(15.034)ニトロタル-イソプロピル、(15.035)オキサモカルブ(oxamocarb)、(15.036)オキシフェンチイン(oxyfenthien)、(15.037)ペンタクロロフェノールおよび塩、(15.038)フェノトリル、(15.039)亜リン酸およびその塩、(15.040)プロパモカルブ-ホセチレート(propamocarb-fosetyl ate)、(15.041)プロパノシン-ナトリウム(propanosine-sodium)、(15.042)ピロルニトリル、(15.043)テブフロキン、(15.044)テクロフタラム、(15.045)トルニファニド、(15.046)トリアゾキシド、(15.047)トリクラミド、(15.048)ザリラミド、(15.049)1-(4-{4-[5R]-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル]-1,3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン、(15.050)1-(4-{4-[5S]-5-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル]-1,3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン、(15.051)オキサチアピプロリン、(15.052)1-(4-メトキシフェノキシ)-3,3-ジメチルブタン-2-イル1H-イミダゾール-1-カルボキシレート、(15.053)2,3,5,6-テトラクロロ-4-(メチルスルホニル)ピリジン、(15.054)2,3-ジブチル-6-クロロエチノ[2,3-d]ピリミジン-4(3H)-オン、(15.055)2,6-ジメチル-1H,5H-[1,4]ジチイノ[2,3-c:5,6-c]ジピロール-1,3,5,7(2H,6H)-テトロン、(15.056)2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-(4-{4-[5R]-5-フェニル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)エタノン、(15.057)2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-(4-{4-[5S]-5-フェニル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)エタノン、(15.058)2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-(4-{4-[5-フェニル-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)エタノン、(15.059)2-ブトキシ-6-ヨード-3-ブロピル-4H-クロメン-4-オン、(15.060)2-クロロ-5-[2-クロロ-1-(2,6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル)-4-メチル-1H-イミダゾール-5-イル]ピリジン、(15.061)2-フェニルフェノールおよび塩、(15.062)3-(4,4,5-トリフルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、(15.063)3,4,5-トリクロロピリジン-2,6-ジカルボニトリル、(15.064)5-アミノ-1,3,4-チアジアゾール-2-チオール、(15.065)5-クロロ-N-フェニル-N-(プロパ-2-イン-10

20

30

40

50

1 - イル) チオフェン - 2 - スルホノヒドラジド、(15.066) 5 - フルオロ - 2 - [ (4 - フルオロベンジル) オキシ] ピリミジン - 4 - アミン、(15.067) 5 - フルオロ - 2 - [ (4 - メチルベンジル) オキシ] ピリミジン - 4 - アミン、(15.068) 5 - メチル - 6 - オクチル [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 7 - アミン、(15.069) (2Z) - 3 - アミノ - 2 - シアノ - 3 - フェニルアクリル酸エチル、(15.070) N - (4 - クロロベンジル) - 3 - [3 - メトキシ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、(15.071) N - [ (4 - クロロフェニル) (シアノ) メチル] - 3 - [3 - メトキシ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] プロパンアミド、(15.072) N - { (E) - [ (シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2, 3 - ジフルオロフェニル] メチル} - 2 - フェニルアセトアミド、(15.073) N - { (Z) - [ (シクロプロピルメトキシ) イミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2, 3 - ジフルオロフェニル] メチル} - 2 - フェニルアセトアミド、(15.074) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - N - (1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド、(15.075) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - N - [(1R) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド、(15.076) N - メチル - 2 - (1 - { [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - N - [(1S) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 4 - カルボキサミド、(15.077) {6 - [ ( { [ (1 - メチル - 1H - テトラゾール - 5 - イル) (フェニル) メチレン] アミノ} オキシ) メチル] ピリジン - 2 - イル} カルバミン酸ベンチル、(15.078) フェナジン - 1 - カルボン酸、(15.079) キノリン - 8 - オール、(15.080) キノリン - 8 - オールスルフェート (2 : 1)、(15.081) {6 - [ ( { [ (1 - メチル - 1H - テトラゾール - 5 - イル) (フェニル) メチレン] アミノ} オキシ) メチル] ピリジン - 2 - イル} カルバミン酸tert-ブチル、(15.082) (5 - ブロモ - 2 - メトキシ - 4 - メチルピリジン - 3 - イル) (2, 3, 4 - トリメトキシ - 6 - メチルフェニル) メタノン、(15.083) N - [2 - (4 - { [3 - (4 - クロロフェニル) プロパ - 2 - イン - 1 - イル] オキシ} - 3 - メトキシフェニル) エチル] - N 2 - (メチルスルホニル) バリンアミド、(15.084) 4 - オキソ - 4 - [ (2 - フェニルエチル) アミノ] ブタン酸、(15.085) ブタ - 3 - イン - 1 - イル {6 - [ ( { [ (Z) - (1 - メチル - 1H - テトラゾール - 5 - イル) (フェニル) メチレン] アミノ} オキシ) メチル] ピリジン - 2 - イル} カルバメート、(15.086) 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 - オール (互変異性体形態: 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 (1H) - オン)、(15.087) 3, 4, 5 - トリヒドロキシ安息香酸プロピル、(15.088) 2 - (6 - ベンジルピリジン - 2 - イル) キナゾリン、(15.089) 2 - [6 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 - メチルピリジン - 2 - イル] キナゾリン、(15.090) 3 - (4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル) キノリン、(15.091) アブシシン酸、(15.092) 9 - フルオロ - 2, 2 - ジメチル - 5 - (キノリン - 3 - イル) - 2, 3 - ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾオキサゼピン、(15.093) 2 - {2 - フルオロ - 6 - [ (8 - フルオロ - 2 - メチルキノリン - 3 - イル) オキシ] フェニル} プロパン - 2 - オール、(15.094) 2 - {2 - [(7, 8 - ジフルオロ - 2 - メチルキノリン - 3 - イル) オキシ] - 6 - フルオロフェニル} プロパン - 2 - オール、(15.095) 2 - [3, 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 - [4 - {5 - [2 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル] - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 3 - イル} - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル] ピペリジン - 1 - イル] エタノン、(15.096) 2 - [3, 5 - ビス (

10

20

30

40

50



**【 0 0 4 6 】**

本発明はさらに、コーヒーさび病、カンキツ類黒星病、カンキツ類瘡痂病またはバナナブラックシガトカ病の防除に有効な量の少なくとも一つの本明細書で定義の式(Ⅰ)の化合物またはそれの塩を含む、植物処理用の噴霧溶液を提供する。その噴霧溶液は、他の一般的構成成分、例えば溶媒、製剤補助剤、特には水を含んでいても良い。さらなる構成成分は、本明細書に記載の農薬有効成分を含んでいても良い。

**【 0 0 4 7 】**

本発明はさらに、コーヒーさび病、カンキツ類黒星病、カンキツ類瘡痂病またはバナナブラックシガトカ病の防除を高めるための相当する噴霧溶液の使用を提供する。以下の記述は、少なくとも一つの本明細書で定義の式(Ⅰ)の化合物またはそれの塩の本発明の使用自体および相当する噴霧溶液、ならびに前記化合物、それの塩および相当する噴霧溶液を施用することを含む本発明の方法の両方に適用される。10

**【 0 0 4 8 】**

本発明による処理方法は、遺伝子改変した生物(GMOs)、例えば、植物または種子の処理で使用することができる。遺伝子改変した植物(またはトランスジェニック植物)は、異種遺伝子がゲノム中に安定に組み込まれている植物である。「異種遺伝子」という表現は、本質的に、植物の外側で提供または組み立てられ、かつ、細胞核ゲノム、クロロプラストゲノムまたはミトコンドリアゲノムに導入すると、形質転換された植物に、対象となるタンパク質もしくはポリペプチドを発現することで、またはその植物に存在する他の遺伝子を低下またはサイレンシングすることにより(例えば、アンチセンス技術、共抑制技術またはRNAi干渉[RNAi]技術またはマイクロRNA[miRNA]技術を用いる)、新たなもしくは改善された農学的その他の特性を与える遺伝子を意味する。ゲノム中に存在する異種遺伝子は、同様にトランス遺伝子と呼ばれる。植物のゲノム中でのその特定の位置によって定義されるトランス遺伝子は、形質転換またはトランスジェニック事象と呼ばれる。20

**【 0 0 4 9 】**

植物種または植物品種、それらの場所および成長条件(土壤、天候、生育期間、栄養)によっては、本発明の処理は、超加算的(「相乗」)効果をもたらすこともある。従って、例えば、実際に起こると予想される効果を超える、施用量の低減および/または活性スペクトルの拡大および/または本発明に従って使用することができる活性化合物および組成物の活性の向上、植物成長の改善、高温もしくは低温に対する耐性の向上、干魃または水もしくは土壤の塩含有量に対する耐性向上、開花能の向上、収穫の簡易化、成熟の加速、収穫高の増大、より大きい果実、より高い植物、より濃い緑色の葉、より容易な開花、収穫物の品質向上および/または栄養価の上昇、収穫物の保存安定性および/または加工性の向上が可能である。30

**【 0 0 5 0 】**

一定の施用量では、本発明による活性化合物の組み合わせは、植物における増強効果を有する可能性もある。したがって、それらは、望ましくない微生物による攻撃に対する植物の防御システムの動員にも適している。これは、適切である場合、例えば真菌に対する本発明による組み合わせの向上した活性の理由の一つであり得る。植物増強性(抵抗性誘発性)物質は、本願の関連において、続いて望ましくない微生物を接種された場合に、処理される植物が、かなりの程度のこれら微生物に対する抵抗性を示すように植物の防御システムを刺激することができる物質または物質の組み合わせも意味するものと理解すべきである。この場合、望ましくない微生物とは、植物病原性の真菌、細菌およびウィルスを意味するものと理解すべきである。従って、本発明による物質は、処理後のある一定の時間内に、上記の病原体による攻撃に対して植物を保護するのに使用できる。保護が行われる期間は、活性化合物で植物を処理してから、一般には1から10日間、好ましくは1から7日間に及ぶ。40

**【 0 0 5 1 】**

本発明に従って使用される式(Ⅰ)の化合物またはそれの塩は、一般的な製剤、例えば

50

液剤、乳濁液、水和剤、水系および油系の懸濁剤、粉剤、ダスト剤、ペースト、可溶性粉体、可溶性粒剤、散布用粒剤、サスペンション濃縮物、有効成分を含浸させた天然化合物、有効成分を含浸させた合成物質、肥料、およびポリマー物質中のマイクロカプセルへ変換することができる。本発明の文脈において、式(I)の4-フェニル酪酸またはそれの塩を噴霧製剤の形態で用いる場合が特に好ましい。

#### 【0052】

噴霧施用のための製剤は、公知の方法で、例えば式(I)の4-フェニル酪酸またはそれの塩を、增量剤、すなわち液体溶媒および/または固体担体と、適宜に界面活性剤、すなわち乳化剤および/または分散剤および/または泡形成剤を使用して混合することにより製造される。さらなる一般的な添加剤、例えば一般的な増量剤および溶媒または希釈剤、色素、湿潤剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、防腐剤、二次増粘剤、固着剤、ジベレリン類および水も、適宜に使用することができる。製剤は、好適な工場で、または施用前もしくは施用の間のいずれかで製造される。10

#### 【0053】

使用される補助剤は、組成物自体および/またはそれから誘導された製剤（例えば噴霧液）に、特定の特性、例えば特定の技術的特性および/または他の特別の生理的特性を付与するのに適した物質であることができる。代表的な補助剤としては、增量剤、溶媒および担体などがある。

#### 【0054】

好適な增量剤は、例えば、水、極性および非極性の有機化学的液体、例えば芳香族および非芳香族炭化水素（例えばパラフィン類、アルキルベンゼン類、アルキルナフタレン類、クロロベンゼン類）、アルコール類および多価アルコール類（それは、適切な場合には、置換、エーテル化および/またはエステル化されていてもよい）、ケトン類（例えば、アセトン、シクロヘキサン）、エステル類（脂肪類および油類など）および（ポリ）エーテル類、置換されていないおよび置換されているアミン類、アミド類、ラクタム類（例えば、N-アルキルピロリドン類）およびラクトン類、スルホン類およびスルホキシド類（例えば、ジメチルスルホキシド）の種類からのものである。20

#### 【0055】

使用する增量剤が水である場合、例えば有機溶媒を補助溶媒として使用することもできる。本質的に、有用な液体溶媒には、芳香族化合物、例えば、キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレン類、塩素化芳香族化合物または塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン類、クロロエチレン類または塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサンまたはパラフィン類、例えば、石油留分、鉱油および植物油、アルコール類、例えば、ブタノールまたはグリコールとそれらのエーテルおよびエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンまたはシクロヘキサン、強極性溶媒、例えば、ジメチルスルホキシド、さらには水などがある。30

#### 【0056】

無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタンおよびブルーシアンブルーおよびアリザリン色素、アゾ色素および金属フタロシアニン色素などの有機色素および鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩などの微量栄養素を用いることが可能である。40

#### 【0057】

本発明に従って使用可能な製剤中に存在し得る有用な湿潤剤は、湿潤を促進し、農薬有効成分の製剤に従来使用される全ての物質である。アルキルナフタレンスルホネート、例えばジイソプロピルまたはジイソブチルナフタレンスルホネートを使用することが好ましい。

#### 【0058】

本発明に従って使用可能な製剤中に存在し得る有用な分散剤および/または乳化剤は、農薬有効成分の製剤に従来使用される全てのノニオン系、アニオン系およびカチオン系の分散剤である。好ましく使用できるものは、ノニオン系もしくはアニオン系分散剤またはノニオン系もしくはアニオン系分散剤の混合物である。好適なノニオン系分散剤は、特に50

、エチレンオキシド／プロピレンオキシドブロックポリマー、アルキルフェノールポリグリコールエーテルおよびトリストリリルフェノールポリグリコールエーテル、およびそのリン酸化もしくは硫酸化誘導体である。好適なアニオン系分散剤は、特別にはリグノスルホン酸塩、ポリアクリル酸塩およびアリールスルホネート／ホルムアルデヒド縮合物である。

#### 【0059】

本発明に従って用いることができる製剤中に存在させることができる消泡剤には、農薬有効成分の製剤に従来使用される全ての発泡禁止化合物がある。シリコーン系消泡剤およびステアリン酸マグネシウムを好ましく用いることができる。

#### 【0060】

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

#### 【0061】

本発明に従って使用することができる製剤中に存在させることができると二次増粘剤には、農薬組成物中でそのような目的で使用可能な全ての物質がある。好ましい例には、セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサンタン、改質粘土および微粉碎シリカなどがある。

#### 【0062】

本発明に従って使用することができる製剤中に存在させることができると接着剤には、種子被覆製品で使用可能な全ての一般的な結合剤がある。ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコールおよびチロースなどが好ましい例である。本発明に従って使用することができる製剤中に存在させることができるとジベレリン類は、好ましくはジベレリンA1、A3(=ジベレリン酸)、A4およびA7であり、ジベレリン酸が特に好ましく使用される。ジベレリン類は公知である(R. Wegler Chemie der Pflanzenschutz- und Schaedlingsbekämpfungsmittel [Chemistry of the Crop Protection Compositions and Pesticides], vol. 2, Springer Verlag, 1970, p. 401-412参照)。

#### 【0063】

さらに別の添加剤は、香料、改質されていても良い鉛油もしくは植物油、口ウおよび栄養素(微量栄養素を含む)、例えば鉄、マンガン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩である。さらに、安定剤、例えば低温安定剤、抗酸化剤、光安定剤または化学的および/または物理的安定性を改善する他の剤を存在させることができる。

#### 【0064】

製剤は一般的に、0.01から98重量%、好ましくは0.5から90重量%の式(I)の4-フェニル酪酸および/またはその塩を含有する。

#### 【0065】

本明細書で定義の式(I)の化合物またはその塩は、市販製剤中に、およびこれらの製剤から調製された使用形態で、他の活性化合物、例えば殺虫剤、誘引剤、滅菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、成長調節剤、除草剤、薬害軽減剤、肥料またはセミオケミカルとの混合物として存在することができる。

#### 【0066】

本発明の化合物の製造および使用を、下記の実施例によって説明する。

#### 【0067】

Tが酸素原子を表す式(I)のN-シクロプロピルアミドは、WO-2007/087906(方法P1)およびWO-2010/130767(方法P1-段階10)による置換されたN-シクロプロピルベンジルアミンと3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボニルクロライドの縮合によって製造する

10

20

30

40

50

ことができる。

**【0068】**

置換されたN - シクロプロピルベンジルアミンは公知であるか、置換されたアルデヒドとシクロプロパンアミンによる還元的アミノ化などの公知の方法 ( J . Med . Chem . , 2012 , 55 ( 1 ) , 169 - 196 ) または置換されたベンジルアルキル ( もしくはアリール ) スルホネートもしくは置換されたベンジルハライドのシクロプロパンアミンによる求核置換 ( Biolog . Med . Chem . , 2006 , 14 , 8506 - 8518 および WO - 2009 / 140769 ) によって製造することができる。

**【0069】**

3 - ( ジフルオロメチル ) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボニルクロライドは、 WO - 2010 / 130767 に従って製造することができる ( 方法 P1 - 段階 9 または 11 ) 。

**【0070】**

T が硫黄原子を表す式 ( I ) の N - シクロプロピルチオアミドは、 WO - 2009 / 016220 ( 方法 P1 ) および WO - 2010 / 130767 ( 方法 P3 ) に従って、 T が酸素原子を表す式 ( I ) の N - シクロプロピルアミドを硫化することで製造することができる。

**【0071】**

下記の実施例は、本発明による式 ( I ) の化合物の製造を説明するものであるが、それは限定的なものではない。

**【0072】**

N - シクロプロピル - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 5 - フルオロ - N - ( 2 - イソプロピルベンジル ) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド ( 化合物 A1 ) の製造

段階 A : N - ( 2 - イソプロピルベンジル ) シクロプロパンアミンの製造

シクロプロパンアミン 55.5 g ( 971 mmol ) のメタノール ( 900 mL ) 中溶液に、 3 モレキュラーシーブス 20 g および酢酸 73 g ( 1.21 mol ) の順で加える。次に、 2 - イソプロピル - ベンズアルデヒド 72 g ( 486 mmol ) を滴下し、反応混合物をさらに 4 時間加熱還流させる。

**【0073】**

次に、反応混合物を冷却して 0 とし、水素化シアノホウ素ナトリウム 45.8 g ( 72.9 mmol ) を 10 分以内に少量ずつ加え、反応混合物を再度 3 時間攪拌還流させる。冷却した反応混合物を珪藻土のケーキで濾過する。そのケーキを多量のメタノールによって洗浄し、メタノール性抽出液を減圧下に濃縮する。次に、水を残留物に加え、 pH を 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 400 mL で 1.2 に調節する。水相を酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し ( 300 mL で 2 回 ) 、硫酸マグネシウムで脱水して、 N - ( 2 - イソプロピルベンジル ) シクロプロパンアミン 81.6 g ( 88 % ) を黄色油状物として得て、それをそのまま次の段階で用いる。

**【0074】**

塩酸塩は、 N - ( 2 - イソプロピルベンジル ) シクロプロパンアミンをジエチル - エテル ( 1.4 mL / g ) に 0 で溶解させ、次に 2 M 塩酸のジエチルエーテル中溶液 ( 1.05 当量 ) を加えることで製造することができる。 2 時間攪拌後、 N - ( 2 - イソプロピルベンジル ) シクロプロパンアミン塩酸塩 ( 1 : 1 ) を濾過し、ジエチルエーテルによって洗浄し、 40 で 48 時間真空乾燥させる。 Mp ( 融点 ) = 149 。

**【0075】**

段階 B : N - シクロプロピル - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 5 - フルオロ - N - ( 2 - イソプロピルベンジル ) - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミドの製造

N - ( 2 - イソプロピルベンジル ) シクロプロパンアミン 40.8 g ( 19.2 mmol ) の脱水テトラヒドロフラン ( 1 リットル ) に室温で、トリエチルアミン 51 mL ( 36 )

10

20

30

40

50

6 mmol) を加えた。次に、3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボニルクロライド 39.4 g (174 mmol) に脱水テトラヒドロフラン (800 mL) 中溶液を、温度を 34 以下に維持しながら滴下する。反応混合物を 2 時間加熱攪拌してから、室温で終夜放置する。塩を濾過し、濾液を減圧下に濃縮して、褐色油状物 78.7 g を得る。シリカゲルでのカラムクロマトグラフィー (750 g - 勾配 n-ヘプタン / 酢酸エチル) によって、N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド 53 g (収率 71%) 黄色油状物として得て、それはゆっくり結晶化する。融点 = 76 から 79。

## 【0076】

10

同じようにして、化合物 A2 から A19 を、化合物 A1 について記載の製造に従って製造することができる。

## 【0077】

N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボチオアミド (化合物 A20) の製造

五硫化リン 14.6 g (65 mmol) および N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド 48 g (131 mmol) のジオキサン (500 mL) 中溶液を 100 で 2 時間加熱する。水 50 mL を加え、反応混合物をさらに 100 でさらに 1 時間加熱する。冷却した反応混合物を塩基性アルミナカートリッジで濾過する。カートリッジをジクロロメタンによって洗浄し、合わせた有機抽出液を硫酸マグネシウムで脱水し、減圧下に濃縮して、橙赤色油状物 55.3 g を得る。残留物を、結晶化が起こるまでジエチルエーテル数 mL で磨碎する。結晶を濾過し、40 で 15 時間真空乾燥して、N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボチオアミド 46.8 g (収率 88%) を得る。融点 = 64 から 70。

## 【0078】

表 1 は、化合物 A1 から A20 の log P および NMR データ (<sup>1</sup>H) を提供するものである。

30

## 【0079】

表 1において、log P 値は、下記の方法を用い、逆相カラム (C18) での HPLC (高速液体クロマトグラフィー) によって、EEC 通達 79/831 補遺 V.A8 に従って測定した。

## 【0080】

温度 : 40 ; 移動相 : 0.1% ギ酸水溶液およびアセトニトリル; 10% アセトニトリルから 90% アセトニトリルの直線勾配。

## 【0081】

較正は、log P 値が既知である未分岐アルカン-2-オン類 (炭素原子数 3 から 16) を用いて行った (連続するアルカノン間の直線内挿を用いる保持時間によって log P 値を測定)。200 nm から 400 nm の UV スペクトラムおよびクロマトグラフィーシグナルのピーク値を用いて、<sub>m a x</sub> 値を求めた。

40

【表1】

物 化 合 物	logP	NMR
A1	3.35	<sup>1</sup> H NMR (500 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.64 (bs, 4H), 1.21 (d, J=6.60 Hz, 6H), 2.44 - 2.80 (m, 1H), 3.01 - 3.29 (m, 1H), 3.78 (s, 3H), 4.76 (bs, 2H), 6.89 (t, J=54.70 Hz, 1H), 7.12 - 7.33 (m, 4H).
A2	3.44	<sup>1</sup> H NMR (500 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.47 - 0.77 (m, 6H), 0.80 - 1.04 (m, 2H), 1.92 (bs, 1H), 2.66 (bs, 1H), 3.80 (s, 3H), 4.92 (bs, 2H), 6.90 (t, J=54.50 Hz, 1H), 7.01 - 7.25 (m, 4H).
A3	4.06	<sup>1</sup> H NMR (500 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.61 (bs, 4H), 1.46 (s, 9H), 2.77 - 2.98 (m, 1H), 3.89 (s, 3H), 5.05 (bs, 2H), 6.91 (t, J=54.70 Hz, 1H), 7.20 (bs, 3H), 7.35 - 7.48 (m, 1H).
A4	3.76	<sup>1</sup> H NMR (300 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.65 - 0.69 (m, 4H), 1.21 (t, 3H), 2.62 - 2.64 (m, 3H), 3.81 (s, 3H), 4.70 (s, 2H), 6.85 (t, J=54.6 Hz, 1H), 7.04 - 7.22 (m, 3H).
A5	4.09	<sup>1</sup> H NMR (500 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.63 - 0.73 (m, 4H), 1.22 (d, J=6.92 Hz, 6H), 2.59 - 2.87 (m, 1H), 2.98 - 3.30 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 4.74 (bs, 2H), 6.88 (t, J=54.40 Hz, 1H), 7.20 - 7.27 (m, 3H).
A6	3.41	<sup>1</sup> H NMR (300 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.65 - 0.66 (m, 4H), 1.21 (t, 3H), 2.62 (q, 2H), 2.64 (bs, 1H), 3.81 (s, 3H), 4.71 (s, 2H), 6.86 (t, J=54.6 Hz, 1H), 6.89 - 6.95 (m, 2H), 7.13 - 7.18 (m, 1H).
A7	3.70	<sup>1</sup> H NMR (300 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.65 - 0.69 (m, 4H), 1.22 (d, 6H), 2.69 (bs, 1H), 3.10 - 3.14 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 4.75 (s, 2H), 6.86 (t, J=54.6 Hz, 1H), 6.88 - 6.93 (m, 2H), 7.23 - 7.28 (m, 1H).
A8	3.46	<sup>1</sup> H NMR (300 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.60 - 0.66 (m, 6H), 0.89 - 0.95 (m, 2H), 1.82 - 1.84 (m, 1H), 2.73 (bs, 1H), 3.81 (s, 3H), 4.89 (s, 2H), 6.68 - 6.99 (m, 4H).
A9	4.21	<sup>1</sup> H NMR (300 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.64 - 0.68 (m, 4H), 1.56-1.62 (m, 2H), 1.62 - 1.70 (m, 2H), 1.76 - 1.83 (m, 2H), 1.96 - 2.05 (m, 2H), 2.71 (bs, 1H), 3.13 - 3.19 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 4.76 (s, 2H), 6.86 (t, J=54.0 Hz, 1H), 6.87 - 6.97 (m, 2H), 7.23 - 7.28 (m, 1H).
A10	3.65	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.65 (bs, 4H), 1.21 (d, J=6.75 Hz, 5H), 2.29 - 2.59 (m, 1H), 3.00 - 3.36 (m, 1H), 3.79 (s, 3H), 4.83 (s, 2H), 6.68 - 7.06 (m, 2H), 7.13 (d, J=7.78 Hz, 1H), 7.27 - 7.33 (m, 1H).

10

20

30

物 化 合 物 名	logP	NMR
A11	3.70	<sup>1</sup> H NMR (500 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.65 (bs, 4H), 2.31 (s, 3H), 2.64 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 4.73 (bs, 2H), 6.89 (t, J=54.6 Hz, 1H), 7.01-7.14 (m, 3H).
A12	3.99	<sup>1</sup> H NMR (500 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.66 (bs, 4H), 1.22 (d, J=6.97 Hz, 6H), 2.31 (s, 3H), 2.54 - 2.75 (m, 1H), 2.99 - 3.25 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 4.75 (bs, 2H), 6.89 (t, J=53.90 Hz, 1H), 7.01 - 7.23 (m, 3H).
A13	3.76	<sup>1</sup> H NMR (500 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.61 - 0.68 (m, 6H), 0.80 - 1.00 (m, 2H), 1.74 - 2.00 (m, 1H), 2.31 (s, 3H), 2.53 - 2.82 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 4.89 (bs, 2H), 6.83 (t, J=54.80 Hz, 1H), 6.91 - 7.06 (m, 3H).
A14	4.36	<sup>1</sup> H NMR (500 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.62 (m, 4H), 1.44 (s, 9H), 2.28 (s, 3H), 2.74 - 3.02 (m, 1H), 3.83 (bs, 3H), 5.02 (bs, 2H), 6.85 (t, J=54.40 Hz, 1H), 7.01 (bs, 1H), 7.21 - 7.29 (m, 2H).
A15	3.80	<sup>1</sup> H NMR (500 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.50 - 0.67 (m, 4H), 2.81 (bs, 1H), 3.78 (s, 3H), 4.85 (bs, 2H), 6.78 (t, J=55.00 Hz, 1H), 7.20 - 7.29 (m, 2H), 7.54 (d, J=8.17 Hz, 1H).
A16	3.78	<sup>1</sup> H NMR (500 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.55 - 0.70 (m, 4H), 2.37 (s, 3H), 2.72 - 3.04 (m, 1H), 3.83 (bs, 3H), 4.91 (bs, 2H), 6.86 (t, J=54.50 Hz, 1H), 7.10 - 7.20 (m, 2H), 7.54 (d, J=7.89 Hz, 1H).
A17	3.46	<sup>1</sup> H NMR (500 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.47 - 0.64 (m, 4H), 2.29 - 2.55 (m, 1H), 3.80 (s, 3H), 5.05 (s, 2H), 6.95 (t, J=54.40 Hz, 1H), 7.40 (t, J=7.86 Hz, 1H), 7.60 - 7.70 (dd, 2H).
A18	3.62	<sup>1</sup> H NMR (500 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.50 - 0.74 (m, 4H), 2.45 - 2.71 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 4.99 (s, 2H), 6.91 (t, J=54.40 Hz, 1H), 7.45 - 7.57 (m, 2H).
A19	4.04	<sup>1</sup> H NMR (500 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.65 (bs, 4H), 1.20 (t, J=7.43 Hz, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.58 - 2.64 (m, 2H), 3.80 (s, 3H), 4.70 (bs, 2H), 6.89 (t, J=54.70 Hz, 3H), 6.98 (bs, 2H).
A20	4.36	<sup>1</sup> H NMR (500 MHz, CHCl <sub>3</sub> -d): δ ppm 0.55 - 0.84 (m, 4H), 1.27 (d, J=6.97 Hz, 6H), 2.73 - 2.85 (m, 1H), 3.04 - 3.23 (m, 1H), 3.80 (s, 3H), 4.60 - 5.06 (m, 1H), 6.99 - 7.38 (m, 5H).

## 【0082】

## 生物例

1. コーヒー作物でのさび病（ヘミレイア・バスタトリクス（*Hemileia vastatrix*））の防除（圃場試験）。

## 【0083】

2013年および2014年にブラジルで四つの圃場試験を実施して、コーヒーでのヘミレイア・バスタトリクス（*Hemileia vastatrix*）に対する化合物の成績を評価した。

## 【0084】

それらの試験は、落葉とそれに続く収穫量低下の原因となるさび病から樹冠を保護するための標準的な実験実務に従って行った。1リットル当たり化合物100gを含む代表的殺菌剤製剤を、ほとんどの試験で30から50日ごとに3回、連続茎葉噴霧で施用した。噴霧容量は、400Lから500L/haで変動させる。

## 【0085】

評価を葉で行った。データは、未処理植物と比較した葉表面でのさび病に対する効力%で表す。

10

20

30

40

50

【表2】

試験	400-300L/Ha	A	B	C	D
化合物(濃度)	有効成分 施用量 g a.i./ha	効力% (Abbott)	効力% (Abbott)	効力% (Abbott)	効力% (Abbott)
N-(5-クロロ-2-イソプロピルベンジル)-N-シクロプロピルピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ビラゾール-4-カルボキサミド(化合物A5)(100g/L)	50	84	61	95	73
オペラ (エポキシコナゾール + ピラクロストロビン)	50+133				79

## 【0086】

表中で報告の四つの試験で行った評価は、コーヒーさび病に対して、50 g a.i./haで単独で使用された化合物A5の効力が高レベルであることを示している。効率レベルは、推奨用量で用いられる標準薬オペラで得られた範囲と同じ範囲である。そうではあっても、化合物A5は、単独で、そして50 g a.i./haの非常に低用量で用いた場合に前記の高効率を得ることができるが、オペラは二つの有効成分の混合物であり、183 g a.i./ha(50+133)の高濃度で用いられる。

## 【0087】

結論

上記実施例は、化合物A5が50 g a.i./haの低活性剤施用量でコーヒーさび病を防除するための新たな別途手段を代表するものであることを示している。これらの低施用量での効力は、エポキシコナゾールおよびピラクロストロビンの混合物(オペラ)に基づくすでに販売されている調合済み化合物と競合し、それに対して前記最後の混合物は183 g a.i./haの濃度で使用される。

## 【0088】

化合物A5は、オペラより予想外に良好な高効率(かなり低施用量で同等の防除)を有し、農園における化学薬剤投入量低減に関与し得る。

## 【0089】

2. かんきつ類作物での黒星病(グイグナルディア・シリカルパ(Guignardia citricarpa))および瘡痂病(エルシノエ(Elsinoe E)属種)の防除(圃場試験)

五つの圃場試験を2013年および2014年に南アフリカ、ブラジルおよび日本で行って、可販果収量に対して大きな影響を有する二つの主たる疾病に対する化合物の成績を評価した。エルシノエ・ファウセティ(Elsinoe Fawcettii)およびグイグナルディア・シリカルパ(Guignardia citricarpa)は、多くのかんきつ種が宿主となるものである。両方とも果実に寄生することができ、両方とも発展途上国外の輸出を制限する検疫病原体である。これら二つの病原体に対する保護は、輸出市場に関与する上で農業者にとって明瞭な利点を提供するものである。

## 【0090】

これらの試験は、各国における果実を含む樹冠を保護するための標準的実験実務に従って行った。1リットル当たり化合物100 gを含む代表的殺菌剤製剤を、黒星病防除には月1回で5から6回、そして瘡痂病感染の防除には14日毎に1から3回、連続茎葉噴霧で施用する。噴霧容量は2000リットルから3000リットル/haで変動させる。

10

20

30

40

50

## 【0091】

試験グイグナルディア・シトリカルパ (G u i g n a r d i a c i t r i c a r p a) (黒星病) からの結果

【表3】

試験	2000 から 3000L/Ha	A	B	C
化合物 (濃度)	有効成分 施用量 g a.i./100L	効力% (Abbott)	効力% (Abbott)	効力% (Abbott)
N-(5-クロロ-2-イソプロピルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド (化合物 A5) (100g/L)	10	73	72	91.3
	15	70	83	93.9
サンコゼブ (Sancozeb) (マンコゼブ)	160	40	35	-

## 【0092】

これらの評価は、非常に低施用量 (10g から 15g a.i. / 100L) で使用される化合物 A5 が、マンコゼブは非常に高めの施用量 (160g a.i. / 100L) として使用されるにもかかわらず、黒星病を防除するのに現在使用されるマンコゼブより優れた効力を提供することを示すものである。商業的標準薬であるマンコゼブは、同等またはさらに低い効率を得るのにかなり高い a.i. 濃度 (ほぼ 15 倍高い) を必要とする。

## 【0093】

試験エルシノエ・ファウセティ (E l s i n o e F a w c e t t i i) (瘡痂病) からの結果

【表4】

試験	3000L/Ha	A	B
化合物 (濃度)	有効成分 施用量 g a.i./100L	効力% (Abbott)	効力% (Abbott)
N-(5-クロロ-2-イソプロピルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド (化合物 A5) (100g/L)	2.5	96	92
	5	95	70
ストロビーDF (クレソキシムメチル)	23.5	86	82
デラン FL (ジチアノン)	400	65	48

## 【0094】

これらの評価は、非常に低施用量 (2.5g から 5g a.i. / 100L) で使用される化合物 A5 が、黒星病を防除するのに現在使用されている商業的標準薬であるクレソキシムメチルおよびジチアノンより優れた効力を与えることを示しているが、ただし、前記商業的標準薬は非常に高い施用量で使用されるものである (ストロビーDF の場合は約 10 倍高く、ジチアノンの場合は約 160 倍高い)。

## 【0095】

結論

10

20

30

40

50

上記の例は、化合物 A 5 が、非常に低施用量 (15 g a.i./ha 以下) で高レベルの活性をもたらすことで、黒星病および瘡痂病のような検疫疾病に対してかんきつ類農園を大いに保護することを示している。

#### 【0096】

これら低施用量の効力は、商業的化合物より優れているが、ただし、当該商業的化合物は現在、非常に高い施用量で使用されるものであり、少なくとも 10 倍 (クレスキシムメチル)、15 倍 (マンコゼブ) またはさらには 160 倍 (ジチアノン) 高い。化合物 A 5 は、農園における化学薬剤投入量低減に関与し得る。

#### 【0097】

3. バナナ作物でのブラックシガトカ病の防除 (圃場試験) 10  
コスタリカおよびフィリピンで 2013 年に二つの圃場試験を実施して、バナナでのマイコスファエレラ・フィジエンシス (*Mycosphaerella fijiensis*) 感染に対する化合物の成績を評価した。

#### 【0098】

1 リットル当たり化合物 100 g を含む代表的な殺菌剤製剤を、7 から 12 日ごとに、連続茎葉噴霧で施用した。各国でのバナナ農園で通常行われるようにタンクミックスで使用される噴霧補助剤および鉛油を用いて標準的な実験実務に従って、これらの試験を行った。

#### 【0099】

データは、各バナナ植物で試験終了後に存在する健常葉の数で表される (より多くの葉が存在するということは、収穫の量および品質がより良好であるということを意味する。) 20

#### 試験ブラックシガトカ病の結果 - 植物当たりの健常葉の数

【表 5】

試験		A	B
組成物 (濃度)	有効成分 施用量 g a.i./ha	健常葉の数 2DAT7	健常葉の数 25DAT13
未処理		<b>8.5</b>	<b>8.7</b>
N-(5-クロロ-2-イソプロピルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド (化合物 A5) (100g/L)	<b>6.25</b> <b>12.5</b> <b>25</b>	<b>11.5</b> <b>12.2</b> <b>12</b>	<b>13.4</b> <b>14.4</b> <b>16.2</b>
ボスカリド 500g/L	<b>150</b>	-	<b>13.1</b>

#### 【0100】

評価は、非常に低施用量 (6.25 g a.i./ha) で使用される化合物 A 5 が、農園区域でのブラックシガトカ病を防除することができるることを示している。約 + 3 葉 / 植物の平均が、さらなる果実生産レベルにとって大きな利点を提供する。登録された化合物ボスカリドは、試験で測定される等価またはさらにそれより低い効力を得るのに、それより高い施用量を必要とする (150 g a.i./ha)。 40

#### 【0101】

##### 結論

上記の例は、化合物 A 5 が、ブラックシガトカ病に対して植物を大きく保護する上で 2.5 g a.i./ha 以下という非常に低施用量で高レベルの活性を有するバナナ保護の新たな標準薬を代表するものであることを示している。これら低施用量での効力は、少なくと 50

も 6 から 24 倍高い施用量で、すでに使用される登録された化合物ボスカリドと少なくとも等価であり、農園における化学薬剤投入量低減に関与し得る。

---

フロントページの続き

(74)代理人 100137213  
弁理士 安藤 健司  
(74)代理人 100143823  
弁理士 市川 英彦  
(74)代理人 100151448  
弁理士 青木 孝博  
(74)代理人 100196483  
弁理士 川崎 洋祐  
(74)代理人 100203035  
弁理士 五味渕 琢也  
(74)代理人 100185959  
弁理士 今藤 敏和  
(74)代理人 100160749  
弁理士 飯野 陽一  
(74)代理人 100160255  
弁理士 市川 祐輔  
(74)代理人 100202267  
弁理士 森山 正浩  
(74)代理人 100146318  
弁理士 岩瀬 吉和  
(74)代理人 100127812  
弁理士 城山 康文  
(72)発明者 セシリアーノ・ソリス, ロドルフォ  
コスタリカ国、カルタゴ、コラリージョ、カジエ・ヌニエス、ジャノ・ドウ・ロス・アンヘルス  
(72)発明者 ラブルデット, ジルベール  
フランス国、71600・パライユ・ル・モニアル、リュ・アントワーヌ・ルナール・53  
(72)発明者 グエルゾーニ, ロドリーゴ  
ブラジル国、13468-110・アメリカーナ / サンパウロ、ジャルディン・パウリスタ、ルア  
・フンテ・ダ・サウダーデ・1449・アバルタメント・109

審査官 伊藤 幸司

(56)参考文献 特表2014-514311(JP, A)  
特表2012-526768(JP, A)  
国際公開第2015/055707(WO, A1)  
国際公開第2013/141362(WO, A1)  
特開2014-224067(JP, A)  
特表2009-532376(JP, A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

A01N  
A01P  
A01C  
Caplus / REGISTRY (STN)