

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第5580310号
(P5580310)

(45) 発行日 平成26年8月27日 (2014. 8. 27)

(24) 登録日 平成26年7月18日 (2014. 7. 18)

(51) Int. Cl.

F I

A O 1 N 43/54 (2006. 01)

A O 1 N 43/54

C

A O 1 P 3/00 (2006. 01)

A O 1 P 3/00

請求項の数 6 (全 20 頁)

(21) 出願番号 特願2011-521357 (P2011-521357)
 (86) (22) 出願日 平成21年7月31日 (2009. 7. 31)
 (65) 公表番号 特表2011-529915 (P2011-529915A)
 (43) 公表日 平成23年12月15日 (2011. 12. 15)
 (86) 国際出願番号 PCT/US2009/052404
 (87) 国際公開番号 W02010/047866
 (87) 国際公開日 平成22年4月29日 (2010. 4. 29)
 審査請求日 平成24年7月17日 (2012. 7. 17)
 (31) 優先権主張番号 61/137, 736
 (32) 優先日 平成20年8月1日 (2008. 8. 1)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

(73) 特許権者 501035309
 ダウ アグロサイエンシズ エルエルシ
 ー
 アメリカ合衆国 インディアナ州 462
 68, インディアナポリス, ジオンス
 ヴィレ ロード, 9330
 (74) 代理人 100092783
 弁理士 小林 浩
 (74) 代理人 100095360
 弁理士 片山 英二
 (74) 代理人 100120134
 弁理士 大森 規雄
 (74) 代理人 100126354
 弁理士 藤田 尚

最終頁に続く

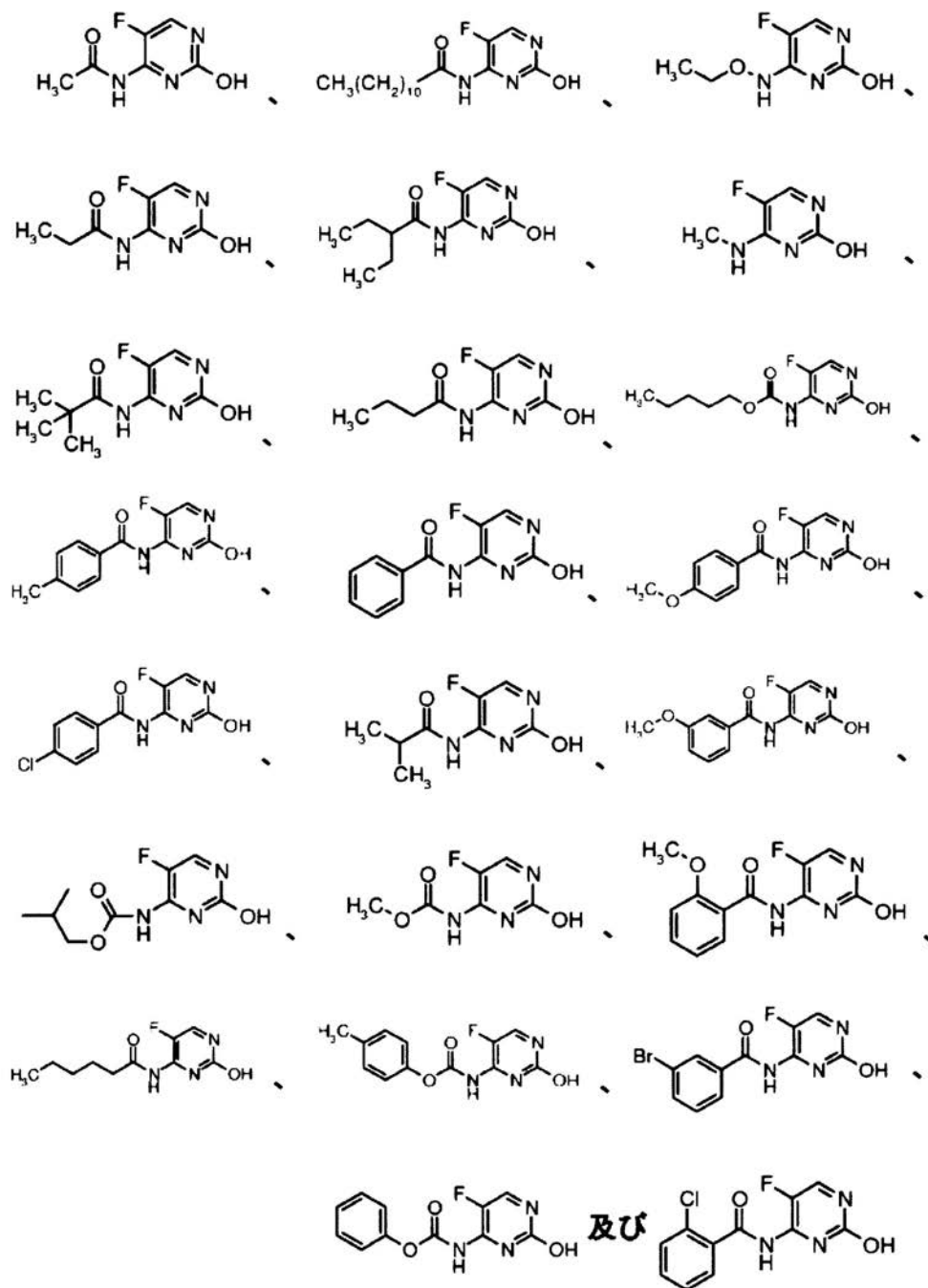
(54) 【発明の名称】 殺真菌剤としての5-フルオロシトシンの使用

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

植物および植物に隣接した地面の1つを下記化合物：

【化 1】



10

20

30

からなる群から選択される化合物を含む組成物と接触させることを含む、病原体により罹病させられるリスクがある植物における病原体誘発性疾患を防除する方法。

40

【請求項 2】

前記疾患を誘発する病原体が真菌病原体である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

前記組成物が殺虫剤をさらに含む、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 4】

前記組成物が雑草防除剤をさらに含む、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 5】

前記疾患がリンゴ黒星病、コムギの葉枯病、テンサイの褐斑病、ラッカセイの褐斑病、キュウリ炭疽病およびシガトカ病の 1 つである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 6】

50

前記病原体がリンゴ黒星病菌、コムギ葉枯病菌、テンサイ褐斑病菌、ラッカセイ褐斑病菌、ウリ類炭疽病菌およびマイコスフェレラ・フィジエンシスの1つである、請求項1に記載の方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

(関連出願の相互参照)

本出願は、2008年8月1日に出願した米国特許仮出願第61/137,736号の利益を主張するものである。

【0002】

10

本開示は、5-フルオロシトシンおよびその誘導体の分野に関し、また殺真菌剤としてのこれらの化合物の使用に関する。

【背景技術】

【0003】

殺真菌剤は、農業に関連する真菌により引き起こされる損傷から植物を防護し、回復させるように作用する、天然または合成由来の化合物である。一般的に、いかなる単一の殺真菌剤もすべての状況には有用ではない。したがって、より良好な性能を有し、使用することがより容易であり、費用がより低い殺真菌剤を製造するための研究が進行中である。

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

20

【0004】

本開示は、5-フルオロシトシンおよびその誘導体ならびに殺真菌剤としてのそれらの使用に関する。5-フルオロシトシンおよびその誘導体は、子囊菌類、担子菌類、不完全菌類および卵菌類からの防御をもたらす可能性がある。

【0005】

本開示の1つの実施形態は、植物および植物に隣接した地面の1つを5-フルオロシトシンおよび5-フルオロシトシン誘導体の1つを含む組成物と接触させることを含む、病原体により罹病させられるリスクがある植物における病原体誘発性疾患を防除する方法を含む。

【0006】

30

本開示の他の実施形態は、5-フルオロシトシンおよび5-フルオロシトシン誘導体の1つ、或いは5-フルオロシトシンおよび5-フルオロシトシン誘導体の1つを含む組成物の土壌、植物、植物の一部、茎葉および/または種子への散布を含む、植物病原性生物による攻撃に対する植物の保護または植物病原性生物により寄生された植物の治療のための5-フルオロシトシンおよび5-フルオロシトシン誘導体の1つを含む化合物の使用である。

【0007】

さらに、本開示の他の実施形態は、5-フルオロシトシンおよび5-フルオロシトシン誘導体の1つを含む化合物および植物学的に許容できる担体材料を含む、植物病原性生物による攻撃からの植物の保護および/または植物病原性生物により寄生された植物の処理に有用な組成物である。

40

【発明を実施するための形態】

【0008】

本開示の化合物は、商業的に購入するか、またはDuschinsky R.ら、J. Med. Chem., 1996年、9巻、566~572頁; Duschinsky R.およびHofer M., 米国特許第3,309,359号、1967年; Li J.ら、国際公開第2005/080351A1号、2005年; ならびにBautista Rodriguez J.ら、国際公開第2009/071726A1号、2009年などの文献における公知の方法により調製することができる。前述の開示のそれぞれは、参照により本明細書に明示的に組み込まれる。

50

【0009】

本開示の化合物は、化合物として、または化合物を含む製剤として、様々な公知の技術のいずれかにより散布することができる。例えば、該化合物は、植物の商業的価値を損なうことなく、様々な真菌の防除のために植物の根、種子または茎葉に散布することができる。該物質は、一般的に使用される製剤型のいずれかの形で、例えば、液剤、粉剤、水和剤、フロアブル剤または乳剤として散布することができる。

【0010】

好ましくは、本開示の化合物は、5 - フルオロシトシンおよび5 - フルオロシトシン誘導体の少なくとも1つと植物学的に許容できる担体を含む製剤の形で散布する。濃縮製剤は、散布のために水または他の液体に分散させることができ、或いは製剤は、さらに処理せずに散布することができる微粉様または粒剤であってよい。製剤は、農業化学技術分野で標準になっている方法に従って調製することができる。

10

【0011】

本開示は、殺真菌剤としての送達および使用のために、上記化合物の1つまたは複数を製剤化することができるすべての媒体を意図する。一般的に、製剤は、水系懸濁剤または乳剤として散布する。そのような懸濁剤または乳剤は、固体であり、通常、水和剤として公知である水溶性、水懸濁性もしくは乳化性製剤、または乳剤、水系懸濁剤もしくはフロアブルとして通常公知である液体から製造することができる。容易に認識されるように、これらの化合物を加えることができる物質は、抗真菌剤としてのこれらの化合物の活性に著しい障害を与えずに、所望の効用をもたらすならば、用いることができる。

20

【0012】

水分散性粒剤を形成するように成形することができる、水和剤は、5 - フルオロシトシンおよび5 - フルオロシトシン誘導体の1つ、不活性担体および界面活性剤を含む緊密な混合物を含む。水和剤中の化合物の濃度は、水和剤の総重量に基づく約10重量% ~ 約90重量%、より好ましくは約25重量% ~ 約75重量%であってよい。水和剤の調製において、化合物を、プロフィライト、タルク、チョーク、石膏、フラー土、ベントナイト、アタパルガイト、デンプン、カゼイン、グルテン、モンモリロナイト粘土、珪藻土、精製ケイ酸塩などの微細な固体と混合することができる。そのような操作において、微細な担体および界面活性剤を一般的に化合物（単数または複数）と混合し、粉碎する。

【0013】

5 - フルオロシトシンおよび5 - フルオロシトシン誘導体の乳剤は、乳剤の総重量に基づく適切な液体中約10重量% ~ 約50重量%などの通常の濃度の化合物を含んでいてよい。化合物は、水混和性溶媒または水混和性有機溶媒と乳化剤との混合物である、不活性担体に溶解することができる。濃縮剤は、水および油で希釈して、水中油型乳剤の形の噴霧混合剤を生成することができる。有用な有機溶媒は、芳香族化合物、特に、重質芳香族ナフサなどの石油の高沸点ナフタレン系およびオレフィン系留分などである。例えば、ロジン誘導体などのテルペン系溶媒、シクロヘキサノンなどの脂肪族ケトンおよび2 - エトキシエタノールなどの複合アルコールなどの他の有機溶媒も用いることができる。

30

【0014】

この件で有利に用いることができる乳化剤は、当業者が容易に決定することができ、種々の非イオン性、陰イオン、陽イオンおよび両性乳化剤、または2つまたはそれ以上の乳化剤の混合物などである。乳剤を調製するのに有用である非イオン性乳化剤の例は、ポリアルキレングリコールエーテルならびにポリオールまたはポリオキシアルキレンで可溶化されたエトキシ化アルキルフェノールおよびカルボン酸エステルなどのアルキルおよびアリールフェノール、脂肪族アルコール、脂肪族アミンまたは脂肪酸とエチレンオキシド、プロピレンオキシドの縮合生成物などである。陽イオン乳化剤は、第四級アンモニウム化合物および脂肪アミン塩などである。陰イオン乳化剤は、アルキルアリールスルホン酸の油性塩（例えば、カルシウム）、油性塩または硫酸化ポリグリコールエーテルおよびリン酸化ポリグリコールエーテルの適切な塩などである。

40

【0015】

50

本発明の化合物の乳剤を調製するのに用いることができる代表的な有機液体は、キシレン、プロピルベンゼン留分などの芳香族液体；または混合ナフタレン留分、鉱油、フタル酸ジオクチルなどの置換芳香族有機液体；ケロセン；種々の脂肪酸のジアルキルアミド、特に脂肪グリコールのジメチルアミドおよびジエチレングリコールの n -ブチルエーテル、エチルエーテルまたはメチルエーテルなどのグリコール誘導体、ならびにトリエチレングリコールのメチルエーテルなどである。2つまたはそれ以上の有機液体の混合物も乳剤の調製に用いることができる。有機液体は、キシレンおよびプロピルベンゼン留分を含み、キシレンが場合によって最も好ましい。界面活性分散剤は、一般的に液体製剤に、分散剤と1つまたは複数の化合物とを合わせた重量に基づく0.1~20重量%の量で用いることができる。製剤は、他の適合性のある添加物、例えば、植物成長調節剤および農業で

10

【0016】

水不溶性5-フルオロシトシンまたは5-フルオロシトシン誘導体を含む水系懸濁剤は、水系懸濁剤の総重量に基づく約5~約50重量%の範囲の濃度で水性媒体中に分散してよい。懸濁剤は、化合物の1つまたは複数を微細に粉碎し、水および上で述べたのと同じ種類のものから選択される界面活性剤を含む媒体中に粉碎した物質を激しく混入することによって調製する。水性媒体の密度および粘度を増大させるために、無機塩および合成または天然ゴムなどの他の成分も加えることができる。

【0017】

5-フルオロシトシンまたは5-フルオロシトシン誘導体は、土壌への散布に特に有用である粒剤としても散布することができる。粒剤は、一般的にアタパルガイト、ベントナイト、珪藻土、粘土または類似の安価な物質などの粗い粒度の不活性物質から完全にまたは大部分なる不活性担体中に分散した、粒剤の総重量に基づく約0.5~約10重量%の化合物（単数または複数）を含む。そのような製剤は、化合物を適切な溶媒に溶解し、それを約0.5~約3mmの範囲の適切な粒径に前成形した粒状担体に加えることによって通常調製される。適切な溶媒は、化合物が実質的または完全に溶ける溶媒である。そのような製剤は、担体および化合物および溶媒の軟塊またはペーストを作り、砕き、乾燥して、所望の粒状粒子を得ることによっても調製することができる。

20

【0018】

5-フルオロシトシンまたは5-フルオロシトシン誘導体を含む粉剤は、粉末状の1つまたは複数の化合物を、例えば、カオリン粘土、粉碎火山岩などの適切な微粉状農業用担体と緊密に混合することによって調製することができる。粉剤は、粉剤の総重量に基づく約1~約10重量%の化合物を適宜含んでよい。

30

【0019】

製剤は、標的作物および生物への化合物の付着、湿展および浸透を促進するためのアジュバント界面活性剤をさらに含んでよい。これらのアジュバント界面活性剤は、製剤の成分として、またはタンクミックスとして任意選択で用いることができる。アジュバント界面活性剤の量は、一般的に水の噴霧容積に基づく0.01~1.0容積%、好ましくは0.05~0.5容積%の範囲で異なるであろう。適切なアジュバント界面活性剤は、エトキシ化ノニルフェノール、エトキシ化合成もしくは天然アルコール、エステル

40

の塩またはスルホコハク酸、エトキシ化有機ケイ素、エトキシ化脂肪アミンおよび界面活性剤と鉱油もしくは植物油との混合物を含むが、これらに限定されない。製剤は、開示が参照により本明細書に特に組み込まれている、米国特許出願第11/495,228号に開示されているような水中油型乳剤も含み得る。

【0020】

製剤は、他の農業化合物を含む混合剤の場合によって含み得る。そのような追加の農業化合物は、散布のために選択される媒体中で本発明の化合物と適合性があり、本発明の化合物の活性に対して拮抗性を示さない、殺真菌剤、殺虫剤、除草剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、殺節足動物剤、殺真菌剤またはその組合せであってよい。したがって、そのような実施形態において、他の農業化合物は、同じまたは異なる農業の使用における補足毒薬として

50

用いることができる。混合剤中の 5 - フルオロシトシンまたは 5 - フルオロシトシン誘導体および農薬化合物は、一般的に 1 : 1 0 0 ~ 1 0 0 : 1 の重量比で存在し得る。

【 0 0 2 1 】

本開示の化合物は、その殺真菌性混合物および共力性混合物を形成するために、他の殺真菌剤と併用することができる。本開示の殺真菌性化合物は、様々な望ましくない疾病を防除するために 1 つまたは複数の他の殺真菌剤とともにしばしば散布される。他の殺真菌剤とともに使用する場合、本願請求項に記載の化合物は、他の殺真菌剤（単数または複数）とともに製剤化、他の殺真菌剤（単数または複数）と混用、或いは他の殺真菌剤（単数または複数）と連続的に散布することができる。そのような他の殺真菌剤は、2 - （チオシアナトメチルチオ） - ベンゾチアゾール、2 - フェニルフェノール、硫酸 8 - ヒドロキシキノリン、アメトクトラジン、アミスルプロム、アンチマイシン、アンペロミセス・キスカリス（*Ampelomyces quisqualis*）、アザコナゾール、アゾキシストロビン、枯草菌（*Bacillus subtilis*）、ペナラキシル、ベノミル、ベンチアバリカルブ - イソプロピル、ベンジルアミノベンゼン - スルホネート（B A B S）塩、重炭酸塩、ピフェニル、ピスメルチアゾール、ピテルタノール、ピキサフェン、プラストサイジン - S、ホウ砂、ボルドー混合物、ボスカリド、プロムコナゾール、ブピリメート、多硫化カルシウム、カプタホル、キャプタン、カルベンダジム、カルボキシシン、カルプロパミド、カルボン、クロロネブ、クロロタロニル、クロゾリネート、コニオスリウムミニタンス（*Coniothyrium minitans*）、水酸化銅、オクタン酸銅、オキシ塩化銅、硫酸銅、硫酸銅（三塩基性）、亜酸化銅、シアゾファミド、シフルフェナミド、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロジニル、ダゾメット、デバカルブ、ジアンモニウムエチレンビス - （ジチオカルバメート）、ジクロフルアニド、ジクロロフェン、ジクロシメット、ジクロメジン、ジクロラン、ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジフェンゾコートイオン、ジフルメトリム、ジメトモルフ、ジモキシストロビン、ジニコナゾール、ジニコナゾール - M、ジノブトン、ジノカップ、ジフェニルアミン、ジチアノン、ドデモルフ、酢酸ドデモルフ、ドジン、ドジン遊離塩基、エジフェンホス、エネストロビン、エボキシコナゾール、エタボキサム、エトキシキン、エトリジアゾール、ファモキサドン、フェナミドン、フェナリモル、フェンプロコナゾール、フェンフラム、フェンヘキサミド、フェノキサニル、フェンピクロニル、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、フェンチン、酢酸フェンチン、水酸化フェンチン、ファーバム、フェリムゾン、フルアジナム、フルジオキサニル、フルモルフ、フルオピコリド、フルオピラム、フルオロイミド、フルオキサストロビン、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルスルファミド、フルチアニル、フルトラニル、フルトリアフォル、フォルベット、ホルムアルデヒド、フォセチル、フォセチル - アルミニウム、フベリダゾール、フララキシル、フラメトピル、グアザチン、酢酸グアザチン、G Y - 8 1、ヘキサクロロベンゼン、ヘキサコナゾール、ヒメキサゾール、イマザリル、硫酸イマザリル、イミベンコナゾール、イミノクタジン、イミノクタジン三酢酸塩、イミノクタジントリス（アルベシレート（*albesilate*））、イプロコナゾール、イプロベンホス、イプロジオン、イプロバリカルブ、イソプロチオラン、イソピラザム、イソチアニル、カスガマイシン、カスガマイシン塩酸塩水和物、クレソキシム - メチル、マンコッパー（*mancopper*）、マンコゼブ、マンジプロパミド、マネブ、メパニピリム、メプロニル、塩化第二水銀、酸化第二水銀、塩化第一水銀、メタラキシル、メフェノキサム、メタラキシル - M、メタム、メタム - アンモニウム、メタム - カリウム、メタム - ナトリウム、メトコナゾール、メタスルホカルブ、ヨウ化メチル、イソチオシアン酸メチル、メチラム、メトミノストロビン、メトラフェノン、ミルジオマイシン、ミクロブタニル、ナーバム、ニトロタール - イソプロピル、ヌアリモール、オクチリノン、オフレース、オレイン酸（脂肪酸）、オリサストロビン、オキサジキシル、オキシシン - 銅、フマル酸オキスポコナゾール、オキシカルボキシシン、ペフラゾエート、ペンコナゾール、ペンシクロン、ペンフルフェン、ペンタクロロフェノール、ラウリン酸ペンタクロロフェニル、ペンチオピラド、酢酸フェニル水銀、ホスホン酸、フタリド、ピコキシストロビン、ポリオキシシン B、ポリオキシシン、ポリオキシリム、重炭酸カリウム、カリウムヒドロキシキノリンサルフェート、プロベナゾール、

10

20

30

40

50

プロクロラズ、プロシミドン、プロパモカルブ、塩酸プロパモカルブ、プロピコナゾール、
 プロピネブ、プロキナジド、プロチオコナゾール、ピラクロストロピン、ピラメトスト
 ロピン、ピラオシキストロピン、ピラゾホス、ピリベンカルブ、ピリブチカルブ、ピリフ
 ェノックス、ピリメタニル、ピロキロン、キノクラミン、キノキシフェン、キントゼン、
 オオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*) エキス、セダキサン、シルチオフアム、シメ
 コナゾール、ナトリウム 2 - フェニルフェノキシド、重炭酸ナトリウム、ナトリウムペン
 タクロロフェノキシド、スピロキサミン、硫黄、S Y P - Z 0 7 1、S Y P - 0 4 8、タ
 ール油、テブコナゾール、テブフロキン、テクナゼン、テトラコナゾール、チアベンダゾ
 ール、チフルザミド、チオフアネート - メチル、チラム、チアジニル、トルクロホス - メ
 チル、トリルフルアニド、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアゾキシド、トリシ
 クラゾール、トリデモルフ、トリフロキシストロピン、トリフルミゾール、トリホリン、
 トリチコナゾール、バリダマイシン、バリフェナレート、バリフェナール、ピンクロゾリ
 ン、ジネブ、ジラム、ゾキサミド、カンジダオレオフィラ (*Candida oleophila*)、フザ
 リウムオキシスポルム (*Fusarium oxysporum*)、グリオクラジウム属 (*Gliocladium*) 種
 、カミカワタケ (*Phlebiopsis gigantea*)、ストレプトマイセスグリセオビリディス (*St
 reptomyces griseoviridis*)、トリコデルマ属 (*Trichoderma*) 種、(R S) - N - (3
 , 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (メトキシメチル) - スクシンイミド、1 , 2 - ジクロ
 ロプロパン、1 , 3 - ジクロロ - 1 , 1 , 3 , 3 - テトラフルオロアセトン水和物、1 -
 クロロ - 2 , 4 - ジニトロナフタレン、1 - クロロ - 2 - ニトロプロパン、2 - (2 - ヘ
 プタデシル - 2 - イミダゾリン - 1 - イル) エタノール、2 , 3 - ジヒドロ - 5 - フェニ
 ル - 1 , 4 - ジチイン 1 , 1 , 4 , 4 - テトラオキシド、酢酸 2 - メトキシエチル水銀、
 塩化 2 - メトキシエチル水銀、ケイ酸 2 - メトキシエチル水銀、3 - (4 - クロロフェニ
 ル) - 5 - メチルローダニン、チオシアン酸 4 - (2 - ニトロプロブ - 1 - エニル) フェ
 ニル、アンプロピルフォス、アニラジン、アジチラム、多硫化バリウム、B a y e r 3
 2 3 9 4、ペノダニル、ベンキノックス、ベントルロン、ベンザマクリル；ベンザマクリ
 ル - イソブチル、ベンザモルフ、ピナパクリル、硫酸ビス (メチル水銀)、ビス (トリブ
 チルスズ) オキシド、ブチオベート、カドミウム カルシウム 銅 亜鉛 クロメート
 サルフェート、カルバモルフ、C E C A、クロベンチアゾン、クロラニホルメタン、クロ
 ルフェナゾール、クロルキノックス、クリンバゾール、銅ビス (3 - フェニルサリチレー
 ト)、クロム酸銅亜鉛、クフラネブ、硫酸ヒドラジニウム第二銅、クプロバム (*cuprobam*)
)、シクラフラミド、シベンダゾール、シプロフラム、デカフェンチン、ジクロン、ジク
 ロゾリン、ジクロブトラゾール、ジメチリモール、ジノクトン、ジノスルホン、ジノテル
 ボン、ジピリチオン、ジタリムホス、ドジシン、ドラゾキソロン、E B P、E S B P、エ
 タコナゾール、エテム、エチリム (*ethirim*)、フェナミノスルフ、フェナパニル、フェ
 ニトロパン、フルオトリマゾール、フルカルバニル、フルコナゾール、フルコナゾール -
 シス、フルメシクロックス、フロファネート、グリオジン (*glyodine*)、グリセオフルピ
 ン、ハラクリネート (*halacrinat*)、H e r c u l e s 3 9 4 4、ヘキシルチオホス
 、I C I A 0 8 5 8、イソパムホス (*isopamphos*)、イソバレジオン、メベニル、メカル
 ピンジド、メタゾキソロン、メトフロキサム、メチル水銀ジシアンジアミド、メトスルホ
 バックス、ミルネブ、無水ムコクロル酸、ミクロゾリン、N - 3 , 5 - ジクロロフェニル
 - スクシンイミド、N - 3 - ニトロフェニルイタコンイミド、ナタマイシン、N - エチル
 水銀 - 4 - トルエンスルホンアニリド、ニッケルビス (ジメチルジチオカルバメート)、
 O C H、フェニル水銀ジメチルジチオ - カルバメート、硝酸フェニル水銀、フォスジフェ
 ン (*phosdiphen*)、プロチオカルブ；塩酸プロチオカルブ、ピラカルボリド、ピリジニ
 トリル、ピロキシクロル、ピロキシフル、キナセトール；硫酸キナセトール、キナザミド、
 キンコナゾール、ラベンザゾール、サリチルアニリド、S S F - 1 0 9、スルトロペン、
 テコラム、チアジフルオール (*thiadifluor*)、チシオフエン、チオクロルフェンヒム、
 チオフアネート、チオキノックス、チオキシミド、トリアミホス、トリアリモール、トリ
 アズブチル、トリクラミド、ウルバシッド (*urbacid*)、X R D - 5 6 3、およびザリラ
 ミド、I K - 1 1 4 0、ならびにこれらの任意の組合せなどであってよい。

10

20

30

40

50

【 0 0 2 2 】

さらに、本発明の化合物は、その駆除薬混合物および共力性混合物を形成するために、散布のために選択される媒体中で本発明の化合物と適合性があり、本発明の化合物の活性に対して拮抗性を示さない、殺虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、殺節足動物剤、殺真菌剤またはその組合せを含む他の駆除薬と併用することができる。本開示の殺真菌性化合物は、様々な望ましくない病害虫を防除するために1つまたは複数の他の駆除薬とともに散布することができる。他の駆除薬とともに使用する場合、本願請求項に記載の化合物は、他の駆除薬（単数または複数）とともに製剤化、他の駆除薬（単数または複数）と混用、或いは他の駆除薬（単数または複数）と連続的に散布することができる。一般的な殺虫剤は、アロサミジンおよびツリングエンシンなどの抗生物質殺虫剤；スピノサドおよびスピネトラムなどの大環状ラクトン殺虫剤；アバメクチン、ドラメクチン、エマメクチン、エプリノメクチン、イベルメクチンおよびセラメクチンなどのアベルメクチン殺虫剤；レピメクチン、ミルベメクチン、ミルベマイシンオキシムおよびモキシデクチンなどのミルベマイシン殺虫剤；ヒ酸カルシウム、アセト亜ヒ酸銅、ヒ酸銅、ヒ酸鉛、亜ヒ酸カリウムおよび亜ヒ酸ナトリウムなどのヒ素殺虫剤；アナバシン、アザジラクチン、d - リモネン、ニコチン、ピレトリン、シネリン、シネリンI、シネリンII、ジャスモリンI、ジャスモリンII、ピレトリンI、ピレトリンII、クアッシア、ロテノン、リアニアおよびサバディラなどの植物性殺虫剤；ベンダイオカルブおよびカルバリルなどのカルバメート殺虫剤；ベンフラカルブ、カルボフラン、カルボスルファン、デカルボフランおよびフラチオカルブなどのベンゾフラニルメチルカルバメート殺虫剤；ジミタン（dimitan）、ジメチラン、ヒキンカルブおよびピリミカルブなどのジメチルカルバメート殺虫剤；アラニカルブ、アルジカルブ、アルドキシカルブ、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、メソミル、ニトリラカルブ、オキサミル、タジムカルブ、チオカルボキシム、チオジカルブおよびチオフアノックスなどのオキシムカルバメート殺虫剤；アリキシカルブ、アミノカルブ、ブフェンカルブ、ブタカルブ、カーバノレート、クロエトカルブ、ジクレシル（dicresyl）、ジオキサカルブ、EMPC、エチオフエンカルブ、フェネタカルブ、フェノブカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メトルカルブ、メキサカルベート、プロマシル、プロメカルブ、プロボクスル、トリメタカルブ、XMCおよびキシリルカルブなどのフェニルメチルカルバメート殺虫剤；ホウ酸、珪藻土およびシリカゲルなどの乾燥殺虫剤；クロラントラニリプロール、シアントラニリプロールおよびフルベンジアミドなどのジアミド殺虫剤；ジネックス、ジノブロップ、ジノサムおよびDNOCなどのジニトロフェノール殺虫剤；ヘキサフルオロケイ酸バリウム、クリオライト、フッ化ナトリウム、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウムおよびスルフルラミドなどのフッ素殺虫剤；アミトラズ、クロルジメホルム、ホルメタネートおよびホルムパラネートなどのホルミアミジン殺虫剤；アクリロニトリル、二硫化炭素、四塩化炭素、クロロホルム、クロルピクリン、p - ジクロロベンゼン、1, 2 - ジクロロプロパン、ギ酸エチル、二臭化エチレン、二塩化エチレン、エチレンオキシド、シアン化水素、ヨードメタン、臭化メチル、メチルクロロホルム、塩化メチレン、ナフタレン、ホスフィン、フッ化スルフルルおよびテトラクロロエタンなどの燻蒸殺虫剤；ホウ砂、多硫化カルシウム、オレイン酸銅、塩化第一水銀、チオシアン酸カリウムおよびチオシアン酸ナトリウムなどの無機殺虫剤；ピストリフルロン、ブプロフェジン、クロルフルアズロン、シロマジン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフエヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、ペンフルロン、テフルベンズロンおよびトリフルムロンなどのキチン合成阻害剤；エポフェノナン、フェノキシカルブ、ヒドロブレン、キノブレン、メトブレン、ピリプロキシフェンおよびトリブレンなどの幼若ホルモン模倣体；幼若ホルモンI、幼若ホルモンIIおよび幼若ホルモンIIIなどの幼若ホルモン；クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジドおよびテブフェノジドなどの脱皮ホルモンアゴニスト；α - エクジソンおよびエクジステロンなどの脱皮ホルモン；ジオフェノランなどの脱皮阻害剤；プレコセンI、プレコセンIIおよびプレコセンIIIなどのプレコセン；ジシクラニルなどの未分類昆虫成長調節剤；ベンスルタップ、カルタップ、チオシクラムおよびチオスルタップなどのネ

10

20

30

40

50

レイストキシシン類似体殺虫剤；フロニカミドなどのニコチノイド殺虫剤；クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリドおよびチアメトキサムなどのニトログアニジン殺虫剤；ニテンピラムおよびニチアジンなどのニトロメチレン殺虫剤；アセタミプリド、イミダクロプリド、ニテンピラムおよびチアクロプリドなどのピリジルメチル - アミン殺虫剤；プロモ - DDT、カンフェクロル、DDT、pp' - DDT、エチル - DDD、HCH、γ - HCH、リンデン、メトキシクロル、ペンタクロロフェノールおよびTDEなどの有機塩素殺虫剤；アルドリン、プロモシクレン、クロルピシクレン、クロルデン、クロルデコン、ディルドリン、ジロール、エンドスルファン、α - エンドスルファン、エンドリン、HEOD、ヘプタクロール、HHDN、イソベンザン、イソドリン、ケレバンおよびミレックスなどのシクロジエン殺虫剤；ブロムフェンビンホス、クロルフェンビンホス、クロトシキホス、ジクロルボス、ジクロトホス、ジメチルビンホス、ホスピラート、ヘプテノホス、メトクロトホス、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、ナフタロホス、ホスファミドン、プロパホス、TEPPおよびテトラクロルビンホスなどの有機ホスフェート殺虫剤；ジオキサベンゾホス、ホスメチランおよびフェントアートなどの有機チオホスフェート殺虫剤；アセチオン、アミトン、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルメホス、デメフィオン、デメフィオン - O、デメフィオン - S、デメトン、デメトン - O、デメトン - S、デメトン - メチル、デメトン - O - メチル、デメトン - S - メチル、デメトン - S - メチルスルホン、ジスルホトン、エチオン、エトプロホス、IPSP、イソチオアート、マラチオン、メタクリホス、オキシデメトン - メチル、オキシデプロホス、オキシジスルホトン、ホレート、スルホテップ、テルブホスおよびチオメトンなどの脂肪族有機チオホスフェート殺虫剤；アミジチオン、シアントアート、ジメトアート、エトアート - メチル、ホルモチオン、メカルバム、オメトアート、プロトアート、ソファミドおよびバミドチオンなどの脂肪族アミド有機チオホスフェート殺虫剤；クロルホキシム、ホキシムおよびホキシム - メチルなどのオキシム有機チオホスフェート殺虫剤；アザメチホス、クマホス、クミトエート、ジオキサチオン、エンドチオン、メナゾン、モルホチオン、ホサロン、ピラクロホス、ピリダフェンチオンおよびキノチオンなどのヘテロ環式有機チオホスフェート殺虫剤；ジクロホスおよびチクロホスなどのベンゾチオピラン有機チオホスフェート殺虫剤；アジンホス - エチルおよびアジンホス - メチルなどのベンゾトリアジン有機チオホスフェート殺虫剤；ジアリホスおよびホスメットなどのイソインドール有機チオホスフェート殺虫剤；イソキサチオンおよびゾラプロホスなどのイソオキサゾール有機チオホスフェート殺虫剤；クロルブラゾホスおよびピラゾホスなどのピラゾロピリミジン有機チオホスフェート殺虫剤；クロルピリホスおよびクロルピリホス - メチルなどのピリジン有機チオホスフェート殺虫剤；ブタチオホス、ダイアジノン、エトリムホス、リリムホス、ピリミホス - エチル、ピリミホス - メチル、プリミドホス、ピリミタートおよびテブピリムホスなどのピリミジン有機チオホスフェート殺虫剤；キナルホスおよびキナルホス - メチルなどのキノキサリン有機チオホスフェート殺虫剤；アチダチオン、リチダチオン、メチダチオンおよびプロチダチオンなどのチアジアゾール有機チオホスフェート殺虫剤；イサゾホスおよびトリアゾホスなどのトリアゾール有機チオホスフェート殺虫剤；アゾトエート、プロモホス、プロモホス - エチル、カルボフェノチオン、クロルチオホス、シアノホス、サイチオアート、ジカプトン、ジクロフェンチオン、エタホス、ファミフル、フェンクロルホス、フェニトロチオン、フェンスルホチオン、フェンチオン、フェンチオン - エチル、ヘテロホス、ヨードフェンホス、メスルフェンホス、パラチオン、パラチオン - メチル、フェンカプトン、ホスニクロル、プロフェノホス、プロチオホス、スルプロホス、テメホス、トリクロルメタホス - 3およびトリフェノホスなどのフェニル有機チオホスフェート殺虫剤；プトナートおよびトリクロルホンなどのホスホネート殺虫剤；メカルホンなどのホスホノチオエート殺虫剤；ホノホスおよびトリクロロナートなどのフェニルエチルホスホノチオエート殺虫剤；シアノフェンホス、EPNおよびレプトホスなどのフェニルフェニルホスホノチオエート殺虫剤；クルホメート、フェナミホス、ホスチエタン、メホスホラン、ホスホランおよびピリミメタホスなどのホスホルアミデート殺虫剤；アセフェート、イソカルボホス、イソフェンホス、イソフェンホス - メチル、メタミド

10

20

30

40

50

ホスおよびプロペタムホスなどのホスホルアミドチオエート殺虫剤；ジメフォックス、マジドックス、ミパフォックス (mipafox) およびシュラダンなどのホスホロジアミド殺虫剤；インドキサカルブなどのオキサジアジン殺虫剤；メトキサジアゾンなどのオキサジアゾリン殺虫剤；ジアリホス、ホスメットおよびテトラメトリンなどのフタルイミド殺虫剤；テブフェンピラド、トルフェンピラドなどのピラゾール殺虫剤；アセトプロール、エチプロール、フィプロニル、ピラフルプロール、ピリプロールおよびパニリプロールなどのフェニルピラゾール殺虫剤；アクリナトリン、アレトリン、バイオアレトリン、バルトリン、ピフェントリン、ピオエタノメトリン (bioethanomethrin)、シクレトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、 β -シフルトリン、シハロトリン、 γ -シハロトリン、 λ -シハロトリン、シペルメトリン、 α -シペルメトリン、 β -シペルメトリン、 θ -シペルメトリン、 ζ -シペルメトリン、シフェノトリン、デルタメトリン、ジメフルトリン、ジメトリン、エンペントリン、フェンフルトリン、フェンピリトリン、フェンプロパトリン、フェンバレラート、エスフェンバレラート、フルシトリナート、フルバリナート、 τ -フルバリナート、フレスリン、イミプロトリン、メトフルトリン、ベルメトリン、ピオベルメトリン、トランスベルメトリン、フェノトリン、ブラレトリン、プロフルトリン、ピレスメトリン、レスメトリン、ピオレスメトリン、シスメトリン、テフルトリン、テラレトリン、テトラメトリン、トラロメトリンおよびトランスフルトリンなどのピレスロイドエステル殺虫剤；エトフェンプロックス、フルフェンプロックス、ハルフェンプロックス、プロトリフェンブテ (protrifenbute) およびシラフルオフエンなどのピレスロイドエーテル殺虫剤；フルフェネリムおよびピリミジフェンなどのピリミジンアミン殺虫剤；クロルフェナビルなどのピロール殺虫剤；スピロテトラマトなどのテトラミン酸殺虫剤；スピロメシフェンなどのテトロノ酸殺虫剤；ジアフェンチウロンなどのチオ尿素殺虫剤；フルコフロンおよびスルコフロンなどの尿素殺虫剤；ならびにクロサンテル、ナフテン酸銅、クロタミトン、E X D、フェナザフロル、フェノキサクリム、ヒドラメチルノン、イソプロチオラン、マロノベン、メタフルミゾン、ニフルリジド、プリフェネート、ピリダベン、ピリダリル、ピリフルキナゾン、ラフォキサニド、スルホキサフロール、トリアラテンおよびトリアザメートなどの未分類殺虫剤、ならびにそれらの任意の組合せを含むが、これらに限定されない。

【 0 0 2 3 】

さらに、本発明の化合物は、その農薬混合物および共力性混合物を形成するために、散布のために選択される媒体中で本発明の化合物と適合性があり、本発明の化合物の活性に対して拮抗性を示さない、除草剤と併用することができる。本開示の殺真菌性化合物は、様々な望ましくない植物を防除するために1つまたは複数の除草剤とともに散布することができる。除草剤とともに使用する場合、本願請求項に記載の化合物は、除草剤（単数または複数）とともに製剤化、除草剤（単数または複数）と混用、或いは除草剤（単数または複数）と連続的に散布することができる。一般的な除草剤は、アリドクロル、ベフルブタミド、ベンザドックス、ベンジブラム、プロモブチド、カフェンストロール、C D E A、シブラゾール、ジメテナミド、ジメテナミド - P、ジフェナミド、エプロナズ、エトニプロミド、フェントラザミド、フルボキサム、ホメサフェン、ハロサフェン、イソカルバミド、イソキサベン、ナプロバミド、ナブタラム、ペトキサミド、プロピザミド、キノナミドおよびテブタムなどのアミド除草剤；クロラノクリル、シサニリド、クロメプロップ、シプロミド、ジフルフェニカン、エトベンザニド、フェナシュラム、フルフェナセット、フルフェニカン、メフェナセット、メフルイジド、メタミホップ、モナリド、ナプロアニリド、ペンタノクロール、ピコリナフェンおよびプロパニルなどのアニリド除草剤；ベンゾイルプロップ、フラムプロップおよびフラムプロップ - Mなどのアリアルアラニン除草剤；アセトクロール、アラクロール、ブタクロール、ブテナクロール、デラクロール、ジエタチル、ジメタクロール、メタザクロール、メトラクロール、S - メトラクロール、プレチラクロール、プロバクロール、プロピソクロール、プリナクロール、テルブクロール、テニルクロールおよびキシラクロールなどのクロロアセトアニリド除草剤；ベンゾフルオール、ペルフルイドン、ピリミスルファンおよびプロフルアゾールなどのスルホンア

ニリド除草剤；アシュラム、カルバスラム、フェナシュラムおよびオリザリンなどのスルホンアミド除草剤；クロルチアミドなどのチオアミド除草剤；ピラナフォスなどの抗生物質除草剤；クロラムベン、ジカンバ、2, 3, 6 - T B A およびトリカンバなどの安息香酸除草剤；ビスピリバックおよびピリミノバックなどのピリミジニルオキシ安息香酸除草剤；ピリチオバックなどのピリミジニルチオ安息香酸除草剤；クロルタールなどのフタル酸除草剤；アミノピラリド、クロピラリドおよびピクロラムなどのピコリン酸除草剤；キンクロラックおよびキンメラックなどのキノリンカルボン酸除草剤；カコジル酸、C M A、D S M A、ヘキサフルレート、M A A、M A M A、M S M A、亜ヒ酸カリウムおよび亜ヒ酸ナトリウムなどのヒ素除草剤；メソトリオン、スルコトリオン、テフリルトリオンおよびテムボトリオンなどのベンゾイルシクロヘキサジオン除草剤；ベンフレセートおよびエトフメセートなどのベンゾフラニルアルキルスルホネート除草剤；ベンザゾリンなどのベンゾチアゾール除草剤；アシュラム、カルボキサゾール、クロルプロカルブ、ジクロルメート、フェナシュラム、カルブチレートおよびテルブカルブなどのカルバメート除草剤；バルバン、B C P C、カルバスラム、カルベタミド、C E P C、クロルブファム、クロルプロファム、C P P C、デスメジファム、フェニソファム、フェンメジファム、フェンメジファム - エチル、プロファムおよびスウェーブなどのカルバニレート除草剤；アロキシジム、ブトロキシジム、クレトジム、クロプロキシジム、シクロキシジム、プロホキシジム、セトキシジム、テブラロキシジムおよびトラルコキシジムなどのシクロヘキセンオキシム除草剤；イソキサクロルトールおよびイソキサフルトールなどのシクロプロピルイソオキサゾール除草剤；シニドン - エチル、フルメジン、フルミクロラック、フルミオキサジンおよびフルミプロピンなどのジカルボキシイミド除草剤；ベンフラリン、ブトラリン、ジニトラミン、エタルフルラリン、フルクロラリン、イソプロバリリン、メタルプロバリリン、ニトラリン、オリザリン、ペンジメタリン、プロジアミン、プロフルラリンおよびトリフルラリンなどのジニトロアニリン除草剤；ジノフェネート、ジノプロップ、ジノサム、ジノセブ、ジノテルブ、D N O C、エチノフェンおよびメジノテルブなどのジニトロフェノール除草剤；エトキシフェンなどのジフェニルエーテル除草剤；アシフルオルフェン、アクロニフェン、ピフェノックス、クロメトキシフェン、クロルニトロフェン、エトニプロミド、フルオロジフェン、フルオログリコフェン、フルオロニトロフェン、ホメサフェン、フリルオキシフェン、ハロサフェン、ラクトフェン、ニトロフェン、ニトロフルオルフェンおよびオキシフルオルフェンなどのニトロフェニルエーテル除草剤；ダゾメットおよびメタムなどのジチオカルバメート除草剤；アロラック、クロロボン、ダラボン、フルプロパネート、ヘキサクロロアセトン、ヨードメタン、臭化メチル、モノクロル酢酸、S M A および T C A などのハロゲン化脂肪族除草剤；イマザメタベンズ、イマザモックス、イマザピック、イマザビル、イマザキンおよびイマゼタビルなどのイミダゾリノン除草剤；スルファミン酸アンモニウム、ホウ砂、塩素酸カルシウム、硫酸銅、硫酸第一鉄、アジ化カリウム、シアン酸カリウム、アジ化ナトリウム、塩素酸ナトリウムおよび硫酸などの無機除草剤；プロモボニル、プロモキシニル、クロロキシニル、ジクロベニル、ヨードボニル、イオキシニルおよびピラクロニルなどのニトリル除草剤；アミプロフォス - メチル、アニロフォス、ペンスリド、ピラナフォス、ブタミフォス、2, 4 - D E P、D M P A、E B E P、フォサミン、グルホシネート、グルホシネート - P、グルホセートおよびピペロフォスなどの有機リン除草剤；プロモフェノキシム、クロメプロップ、2, 4 - D E B、2, 4 - D E P、ジフェノペンテン、ジスル、エルボン、エトニプロミド、フェンテラコールおよびトリフォブシメなどのフェノキシ除草剤；メタゾール、オキサジアルギル、オキサジアゾンなどのオキサジアゾリン除草剤；フェノキサスルホンなどのオキサゾール除草剤；4 - C P A、2, 4 - D、3, 4 - D A、M C P A、M C P A - チオエチルおよび2, 4, 5 - T などのフェノキシ酢酸除草剤；4 - C P B、2, 4 - D B、3, 4 - D B、M C P B および2, 4, 5 - T B などのフェノキシ酪酸除草剤；クロプロップ、4 - C P P、ジクロルプロップ、ジクロルプロップ - P、3, 4 - D P、フェノプロップ、メコプロップおよびメコプロップ - P などのフェノキシプロピオン酸除草剤；クロラジホップ、クロジナホップ、クロホップ、シハロホップ、ジクロホップ、フェノキサプロ

10

20

30

40

50

ップ、フェノキサプロップ - P、フェンチアプロップ、フルアジホップ、フルアジホップ - P、ハロキシホップ、ハロキシホップ - P、イソキサピリホップ、メタミホップ、プロパキサホップ、キサロホップ、キサロホップ - Pおよびトリホップなどのアリアルオキシフェノキシプロピオン酸除草剤；ジニトラミンおよびプロジアミンなどのフェニレンジアミン除草剤；ピロキサスルホンなどのピラゾール除草剤；ベンゾフェナップ、ピラスルホトール、ピラゾリネート、ピラゾキシフェンおよびトブラメゾンなどのベンゾイルピラゾール除草剤；フルアゾレート、ニピラクロフェン、ピノキサデンおよびピラフルフェンなどのフェニルピラゾリル除草剤；クレダジン、ピリダフォルおよびピリデートなどのピリダジン除草剤；プロムピラゾン、クロリダゾン、ジミダゾン、フルフェンピル、メトフルラゾン、ノルフルラゾン、オキサピラゾンおよびピダノンなどのピリダジノン除草剤；アミノピラリド、クリオジネート、クロピラリド、ジチオピル、フルロキシピル、ハロキシジン、ピクロラム、ピコリナフェン、ピリクロル、チアゾピルおよびトリクロピルなどのピリジン除草剤；イプリミダムおよびチオクロリムなどのピリミジンジアミン除草剤；シペルコート、ジエタムコート、ジフェンゾコート、ジコート、モルファムコートおよびパラコートなどの四級アンモニウム除草剤；ブチレート、シクロエート、ジ - アレート、E P T C、エスプロカルブ、エチオレート、イソポリネート、メチオベンカルブ、モリネート、オルベンカルブ、ペブレート、プロスルホカルブ、ピリブチカルブ、スルファレート、チオベンカルブ、チオカルバジル、トリアレートおよびベルノレートなどのチオカルバメート除草剤；ジメキサノ、E X Dおよびプロキサノなどのチオカーボネート除草剤；メチウロンなどのチオ尿素除草剤；ジプロペトリン、インダジフラム、トリアジフラムおよびトリヒドロキシトリアジンなどのトリアジン除草剤；アトラジン、クロラジン、シアナジン、シブラジン、エグリナジン、イパジン、メソブラジン、プロシアジン、プログリナジン、プロパジン、セブチラジン、シマジン、テルブチラジンおよびトリエタジンなどのクロロトリアジン除草剤；アトラトン、メトメトン、プロメトン、セクブメトン、シメトンおよびテルブメトンなどのメトキシトリアジン除草剤；アメトリン、アジプロトリン、シアナトリン、デスメトリン、ジメタメトリン、メトプロトリン、プロメトリン、シメトリンおよびテルブトリンなどのメチルチオトリアジン除草剤；アメトリジオン、アミブジン、ヘキサジノン、イソメチオジン、メタミトロンおよびメトリブジンなどのトリアジノン除草剤；アミトロール、カフェンストロール、エプロナズおよびフルボキサムなどのトリアゾール除草剤；アミカルバゾン、ベンカルバゾン、カルフェントラゾン、フルカルバゾン、イブフェンカルバゾン、プロボキシカルバゾン、スルフェントラゾンおよびチエンカルバゾン - メチルなどのトリアゾロン除草剤；クロランスラム、ジクロスラム、フロラスラム、フルメツラム、メトスラム、ペノキススラムおよびピロキススラムなどのトリアゾロピリミジン除草剤；ベンズフェンジゾン、プロマシル、ブタフェナシル、フルプロバシル、イソシル、レナシル、サフルフェナシルおよびテルバシルなどのウラシル除草剤；ベンズチアズロン、クミルロン、シクルロン、ジクロラルウレア (dichloralurea)、ジフルフェンゾピル、イソノルロン、イソウロン、メタベンズチアズロン、モニソウロンおよびノルロンなどの尿素除草剤；アニスロン、ブツロン、クロルプロムロン、クロレツロン、クロロトルロン、クロロクスロン、ダイムロン、ジフェノキスロン、ジメフロム、ジウロン、フェヌロン、フルオメツロン、フルオチウロン、イソプロツロン、リヌロン、メチウロン、メチルダイムロン、メトベンズロン、メトプロムロン、メトキスロン、モノリヌロン、モヌロン、ネブロン、パラフルロン、フェノベンズロン、シデュロン、テトラフルロンおよびチジアズロンなどのフェニル尿素除草剤；アミドスルフロム、アジムスルフロム、ベンスルフロム、クロリムロン、シクロスルファムロン、エトキシスルフロム、フラザスルフロム、フルセトスルフロム、フルピルスルフロム、ホラムスルフロム、ハロスルフロム、イマゾスルフロム、メソスルフロム、メタゾスルフロム、ニコスルフロム、オルトスルファムロン、オキサスルフロム、プリミスルフロム、プロピリスルフロム、ピラゾスルフロム、リムスルフロム、スルホメツロン、スルホスルフロムおよびトリフロキシスルフロムなどのピリミジニルスルホニル尿素除草剤；クロルスルフロム、シノスルフロム、エタメトスルフロム、ヨードスルフロム、メトスルフロム、プロスルフロム、チフェ

10

20

30

40

50

ンスルフロン、トリアスルフロン、トリベヌロン、トリフルスルフロンおよびトリトスルフロンなどのトリアジニルスルホニル尿素除草剤；ブチウロン、エチジムロン、テブチウロン、チアザフルロンおよびチジアズロンなどのチアジアゾリル尿素除草剤；ならびにアクロレイン、アリルアルコール、アミノシクロピラクロル、アザフェニジン、ペンタゾン、ベンゾビシクロン、ビシクロピロン、ブチダゾール、カルシウムシアナミド、カンベンジクロル、クロルフェナック、クロルフェンプロップ、クロルフルラゾール、クロルフルレノール、シンメチリン、クロマゾン、C P M F、クレゾール、シアナミド、o - ジクロロ

ベンゼン、ジメピペレート、エンドタール、フルオロミジン、フルリドン、フルクロリドン、フルルタモン、フルチアセット、インダノファン、イソチオシアン酸メチル、O C H、オキサジクロメフォン、ペンタクロロフェノール、ペントキサゾン、酢酸フェニル水銀、プロスルファリン、ピリベンゾキシム、ピリフタリド、キノクラミン、ロデタニル、スルグリカピン、チジアジミン、トリジファン、トリメツロン、トリプロピンダンおよびトリタック (tritac) などの未分類除草剤を含むが、これらに限定されない。

【 0 0 2 4 】

本開示の 1 つの実施形態は、真菌の攻撃を防除または予防する方法である。この方法は、土壌、植物体、根、茎葉、種子または真菌の存在場所または寄生を予防すべき場所に殺真菌上有効な量の 5 - フルオロシトシンまたは 5 - フルオロシトシン誘導体を散布する（例えば、穀類またはブドウ植物に散布する）ステップを含む。化合物は、低い植物毒性を示すと同時に、種々の植物の殺真菌レベルでの処理に適している。化合物は、保護剤および/または殺真菌剤の形で有用であり得る。

【 0 0 2 5 】

化合物は、特に農業用のかなりの殺真菌効果を有することが見いだされた。化合物の多くは、農作物および園芸植物について使用するのに特に有効である。

【 0 0 2 6 】

前述の真菌に対する化合物の有効性は、殺真菌剤としての該化合物の一般的な効用を確立するものであることは、当業者は理解するであろう。

【 0 0 2 7 】

化合物は、殺真菌剤としての広範囲の有効性を有する。散布すべき活性物質の正確な量は、散布する個別の活性物質だけでなく、望まれる個別の作用、防除すべき真菌種およびその成長の段階、ならびに化合物と接触する植物または他の生成物の一部にも依存する。したがって、化合物のすべて、およびそれを含む製剤は、同様な濃度で、または同じ真菌種に対して同等に有効でない可能性がある。

【 0 0 2 8 】

化合物は、疾患抑制および植物学的に許容できる量で植物について用いるのに有効である。「疾患抑制および植物学的に許容できる量」という語は、防除が望まれる植物の疾患を鎮め、または抑制するが、植物に対して著しく有毒でない化合物の量を意味する。この量は、一般的に約 0 . 1 ~ 約 1 0 0 0 p p m (1 0 0 万分率) であり、1 ~ 5 0 0 p p m が好ましい。必要な化合物の正確な量は、防除する真菌病、用いる製剤の種類、散布方法、個別の植物種、気象条件などによって異なる。適切な散布量は、一般的に約 0 . 1 0 ~ 約 4 ポンド / エーカー (約 0 . 0 1 ~ 0 . 4 5 g / c m ²) の範囲にある。

【 0 0 2 9 】

本明細書に示す範囲または望まれる値は、本明細書における教示の理解について当業者に明らかなように、求められる効果を失うことなく、拡大または変更することができる。

【 0 0 3 0 】

生物学的試験

以下の実施例について、5 - フルオロシトシンまたは 5 - フルオロシトシン誘導体をアセトンまたは水に溶解し、所望の散布量を得るために希釈を行った。噴霧溶液は、0 . 0 1 % トリトン X - 1 0 0 または T r y c o l 5 9 4 1 を含んでいた。高容積噴霧について

は、自動ブース噴霧器を用いて植物に噴霧して流した。低容積試験については、殺真菌剤を、200リットル/ヘクタール(L/H)の散布容積でトラック噴霧器を用いて散布した。

【0031】

化合物の散布の3日前(3日治療試験; 3DC)または化合物の散布の1日後(1日保護試験: 1DP)に植物に真菌病原体を接種した。

【実施例】

【0032】

[実施例1]

殺真菌活性の評価: コムギの葉枯病(マイコスフェレラ・グラミニコラ(*Mycosphaerella graminicola*); 病原異名: コムギ葉枯病菌(*Septoria tritici*); BayerコードSEPTTR)

10

コムギ植物(Yuma品種)を、温室内でポット当たり7~10個の実生で最初の葉が完全に出現するまで50%ミネラル土壌/50%ソイルレスMetroミックス中で種子から生育させた。これらの植物に、殺真菌剤処理の前または後にコムギ葉枯病菌の水性孢子懸濁液を接種した。接種後、植物を100%相対湿度に保持して(暗デューチャンパー内に1日の後、照明デューチャンパー内に2~3日)、孢子を発芽させ、葉に感染させた。次いで、植物を温室に移して疾患を発症させた。

【0033】

[実施例2]

20

殺真菌活性の評価: コムギのふ枯病(コムギふ枯病菌(*Leptosphaeria nodorum*); BayerコードLEPTNO; 病原異名: スタゴノスポラ・ノドルム(*Stagonospora nodorum*))

コムギ植物(Yuma品種)を、温室内でポット当たり7~10個の実生で最初の葉が完全に出現するまで50%ミネラル土壌/50%ソイルレスMetroミックス中で種子から生育させた。コムギ実生にコムギふ枯病菌の水性孢子懸濁液を接種した。接種後、植物を100%相対湿度に保持して(暗デューチャンパー内に1日、続いて照明デューチャンパー内に3日)、孢子を発芽させ、葉に感染させた。次いで、植物を温室に移して疾患を発症させた。

【0034】

30

[実施例3]

殺真菌活性の評価: オオムギの斑点病(オオムギ斑点病菌(*Cochliobolus sativum*); BayerコードCOCHSA; 病原異名: ヘルミントスポリウム・サチウブム(*Helminthosporium sativum*))

オオムギ植物(Harrington品種)を、温室内でポット当たり7~10個の実生で最初の葉が完全に出現するまでソイルレスMetroミックス中で種子から生育させた。植物にヘルミントスポリウム・サチウブムの孢子懸濁液を接種した。接種後、オオムギ実生を相対湿度が100%の暗デュールーム内に24時間にわたって入れ、次いで、疾患を発症させるために温室に移した。

【0035】

40

[実施例4]

殺真菌活性の評価: テンサイの褐斑病(テンサイ褐斑病菌(*Cercospora beticola*); BayerコードCERCB E)

テンサイ(HH-88品種)を温室内のソイルレスMetroミックス中で生育させた。孢子は、葉全体を水で洗浄することによって湿潤感染葉表面から収集し、2層のチーズクロスによりろ過した。若い実生に孢子懸濁液を接種した。植物を暗デュールーム内に48時間にわたって保持し、次いで、26℃の温度の温室内のプラスチックフード下に置いた。

【0036】

[実施例5]

50

殺真菌活性の評価：ラッカセイの褐斑病（マイコスフェレラ・アラキジス（*Mycosphaerella arachidis*）；BayerコードMYCOAR；病原異名：ラッカセイ褐斑病菌（*Cercospora arachidicola*））

ラッカセイ実生（Star品種）をソイルレスMetroミックス中で生育させた。胞子は、葉全体を水で洗浄することによって湿潤感染葉表面から収集し、2層のチーズクロスによりろ過した。若い実生に胞子懸濁液を接種した。植物を暗デュールーム内に48時間にわたって保持し、次いで、26℃の温度の温室内のプラスチックフード下に置いた。

【0037】

[実施例6]

殺真菌活性の評価：キュウリ炭疽病（グロメレラ・ラゲナリウム（*Glomerella lagenarium*）；病原異名：ウリ類炭疽病菌（*Colletotrichum lagenarium*）；BayerコードCOLLLA）

10

キュウリ実生（Bush Champion品種）を温室内のソイルレスMetroミックス中で生育させた。キュウリ植物に胞子懸濁液を接種し、暗デュールーム内に一夜保持した。次いで、植物を疾患を発症させるために生育チャンバーに移した。

【0038】

[実施例7]

殺真菌活性の評価：リンゴ黒星病（リンゴ黒星病菌（*Venturia inaequalis*）；BayerコードVENTIN）

リンゴ実生（McIntoshおよびGolden Delicious）を温室内のソイルレスMetroミックス中で生育させた。真菌種子を感染葉組織から収集した。植物に胞子懸濁液を接種した。植物を相対湿度が100%の暗デュールーム内に24時間にわたって入れ、次いで、疾患を発症させるために18℃の温度の温室に移した。

20

【0039】

[実施例8]

殺真菌活性の評価：バナナのシガトカ病（マイコスフェレラ・フィジエンシス（*Mycosphaerella fijiensis*）；BayerコードMYCOFI）

マイコスフェレラ・フィジエンシスに対する有効性は、野外生育バナナ植物の新たに発生した葉を用いて試験した。必要な濃度の5-フルオロシトシンの希釈製剤20mLを各試験葉上の20×20cmの線引きした領域に噴霧した。その後、葉を天然接種物により感染された状態にし、約40～45日後に疾患防除率を目視により評価した。

30

【0040】

以下の表にこれらの実験で評価したときの5-フルオロシトシン（表I）または5-フルオロシトシン誘導体（表II）の活性を示す。疾患の防除における5-フルオロシトシンまたは5-フルオロシトシン誘導体の有効性は、処理した植物における疾患の重症度を評価し、次に無処理の接種植物における疾患のレベルに基づいて、重症度を防除率（%）に変換することによって判定した。

【0041】

【表 1】

表I及びIIの各例における評価尺度は以下の通りである

疾患防除%	評価
76～100	A
51～75	B
26～50	C
0～25	D
試験せず	E

10

【 0 0 4 2 】

【表 2】

表I: 植物疾患に対する5-フルオロシトシンの活性

エントリー 番号	病原体	散布量 ppm 1DP	5-FCの疾患 防除%	散布量 ppm 3DC	5-FCの疾患 防除%
1	COCHSA	200	C	200	E
2	COLLLA	200	A	200	E
3	SEPTTR	200	A	100	A
4	MYCOAR	100	A	100	A
5	CERCBE	100	A	100	E
6	LEPTNO	100	D	100	C
7	VENTIN	75	A	75	A
8	MYCOFI	200	B	100	B

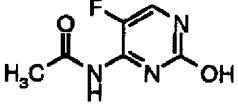
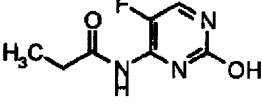
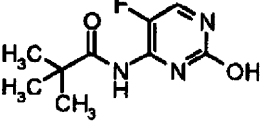
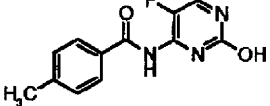
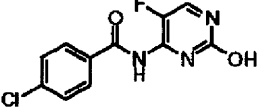
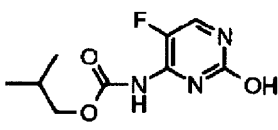
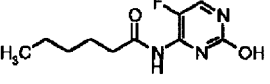
20

30

【 0 0 4 3 】

【表 3】

表II: SEPTTRにおける100ppmの化合物の1日保護(1DP)および3日治療(3DC)活性

化合物	構造	SEPTTR 100 PPM 1DP	SEPTTR 100 PPM 3DC
2		A	A
3		A	A
4		A	A
5		A	B
6		A	C
7		B	B
8		A	A

10

20

30

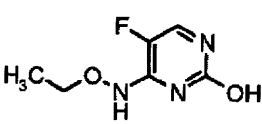
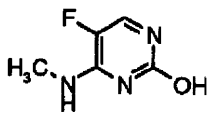
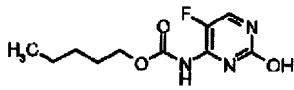
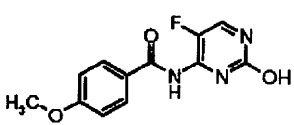
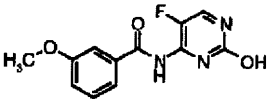
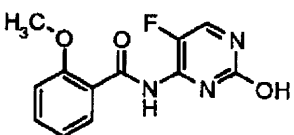
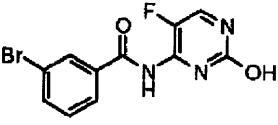
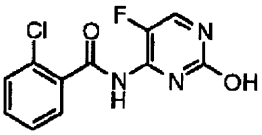
化合物	構造	SEPTTR 100 PPM 1DP	SEPTTR 100 PPM 3DC
9		A	C
10		C	D
11		A	A
12		A	A
13		A	A
14		C	D
15		A	B
16		A	A

10

20

30

40

化合物	構造	SEPTTR 100 PPM 1DP	SEPTTR 100 PPM 3DC
17		C	A
18		D	B
19		D	D
20		D	D
21		D	D
22		D	D
23		C	D
24		C	C

10

20

30

40

フロントページの続き

- (74)代理人 100104282
弁理士 鈴木 康仁
- (72)発明者 ベンコ, ゴルタン
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 2 4 0, インディアナポリス, ノース パーク アベニュー 8 4 0 2
- (72)発明者 ブライアン, クリスティ
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 0 3 3, カーメル, クール クリーク ドライブ 1 5 0 2
- (72)発明者 デービス, ジョージ
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 0 3 2, カーメル, カウント フリート コート 1 5 1 1 4
- (72)発明者 エップ, ジェフリー
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 0 6 2, ノブレスビル, カインダー オーク ドライブ 1 7 9 4 7
- (72)発明者 ロースバッハ, ベス
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 2 2 0, インディアナポリス, ハーバーフォード アベニュー 6 0 3 4
- (72)発明者 メイヤー, ケビン
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 0 7 7, ジオンズビル, レキシントン コート 1 0 0
- (72)発明者 オーウェン, ダブリュ.
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 0 3 3, カーメル, ペブルポイント パス 1 2 4 2 1
- (72)発明者 サレンバーガー, マイケル
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 0 7 4, ウェストフィールド, リバー バーチ ロード 1 5 6 1 0
- (72)発明者 ウェブスター, ジェフリー
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 1 6 3, ニュー ペールスタイン, ダブリュ. オークウッド コート 7 5 8 1
- (72)発明者 ヤング, デービッド
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 0 3 3, カーメル, ナバホ ウェイ 5 2 6 3
- (72)発明者 ヤオ, チェングリン
アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 0 7 4, ウェストフィールド, エスプリ ドライブ 1 4 1 7 8

審査官 三上 晶子

- (56)参考文献 特表2007-527852(JP, A)
米国特許第03368938(US, A)
特開平01-272569(JP, A)
特開昭60-072867(JP, A)
特表2011-510090(JP, A)
国際公開第2008/046757(WO, A1)
特表2002-503726(JP, A)
特表平11-514642(JP, A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

A01N 1/00-65/48
A01P 1/00-23/00
CAplus/REGISTRY(STN)