

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号
特許第7202367号
(P7202367)

(45)発行日 令和5年1月11日(2023.1.11)

(24)登録日 令和4年12月27日(2022.12.27)

(51)国際特許分類	F I			
C 0 7 D 409/12 (2006.01)	C 0 7 D 409/12			C S P
A 0 1 P 3/00 (2006.01)	A 0 1 P 3/00			
A 0 1 N 43/42 (2006.01)	A 0 1 N 43/42	1 0 1		

請求項の数 15 (全85頁)

(21)出願番号	特願2020-515221(P2020-515221)	(73)特許権者	519295993 シンジェンタ パーティシペーションズ アーゲー スイス 4 0 5 8 パーゼル ローゼンタ ールシュトラッセ 6 7
(86)(22)出願日	平成30年9月11日(2018.9.11)	(74)代理人	100094569 弁理士 田中 伸一郎
(65)公表番号	特表2020-533390(P2020-533390 A)	(74)代理人	100103610 弁理士 吉 田 和彦
(43)公表日	令和2年11月19日(2020.11.19)	(74)代理人	100109070 弁理士 須田 洋之
(86)国際出願番号	PCT/EP2018/074501	(74)代理人	100119013 弁理士 山崎 一夫
(87)国際公開番号	WO2019/053016	(74)代理人	100123777 弁理士 市川 さつき
(87)国際公開日	平成31年3月21日(2019.3.21)		
審査請求日	令和3年9月8日(2021.9.8)		
(31)優先権主張番号	17190838.7		
(32)優先日	平成29年9月13日(2017.9.13)		
(33)優先権主張国・地域又は機関	欧州特許庁(EP)		

最終頁に続く

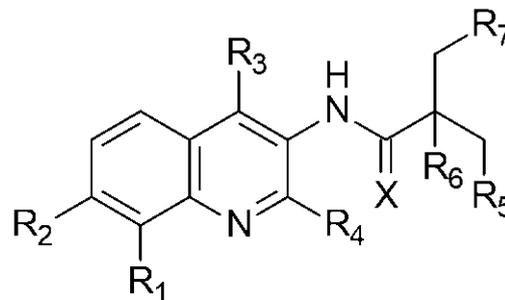
(54)【発明の名称】 殺微生物性キノリン(チオ)カルボキサミド誘導体

(57)【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



(I)

(式中、

Xは、O又はSであり；

R₁は、水素、ハロゲン、メチル又はシアノであり；R₂は、水素、メチル又はハロゲンであり；R₃及びR₄は各々、水素、ハロゲン及びメチルから独立して選択され；

R₅は、C₁~C₄アルキル、C₂~C₄アルケニル又はC₃~C₆シクロアルキルであり、ここで、前記アルキル、アルケニル及びシクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル、C₁~C₃アルコキシ及びC₁~C₃アルキルチオから独立して選択される1~3個の置換基で任意に置換されていてもよく；

R₆は、水素、フルオロ、クロロ、シアノ又はC₁~C₄アルキルであり；

R₇は、C₄~C₁₀飽和若しくは部分不飽和複素環又はヘテロアリアルであり、ここで、前記複素環又はヘテロアリアルは、N、O及びSから選択される1個、2個又は3個のヘテロ原子を含有し、炭素又は窒素原子を介して結合され、ハロゲン、シアノ、C₁~C₃アルキル、C₁~C₃アルコキシ、C₁~C₃アルキルチオ、C₁~C₃ハロアルキル、C₁~C₃ハロアルコキシ、C₁~C₃ハロアルキルチオ及びC₃~C₅シクロアルキルから独立して選択される1個以上の置換基で任意に置換されていてもよい)

10

の化合物；

又はその塩、鏡像異性体若しくはN - オキシド。

【請求項2】

R₁が、水素、フルオロ、クロロ、メチル又はシアノである、請求項1に記載の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくはN - オキシド。

【請求項3】

R₂が、水素、メチル、クロロ又はフルオロである、請求項1又は2に記載の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくはN - オキシド。

【請求項4】

20

R₃及びR₄が各々、水素及びメチルから独立して選択される、請求項1、2又は3のいずれか一項に記載の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくはN - オキシド。

【請求項5】

R₅が、C₁~C₄アルキル、C₂~C₄アルケニル又はC₃~C₆シクロアルキルであり、ここで、前記アルキル、アルケニル及びシクロアルキルは、フルオロ、クロロ及びC₁~C₃アルキルから独立して選択される1~3個の置換基で任意に置換されていてもよい、請求項1、2、3又は4のいずれか一項に記載の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくはN - オキシド。

【請求項6】

R₆が、水素、フルオロ、クロロ又はC₁~C₃アルキルである、請求項1、2、3、4、又は5のいずれか一項に記載の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくはN - オキシド。

30

【請求項7】

R₇が、チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1,2,4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル(ここで、環員メチレン基のうちの1つは、C=O、C=CH₂又はC=CF₂を任意に表し得る)、ピリダジニル、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4,5 - ジヒドロ - 3H - ピリダジニル又はピリジニルであり、ここで、前記チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1,2,4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル、ピリダジニル、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4,5 - ジヒドロ - 3H - ピリダジニル及びピリジニルは、フルオロ、クロロ、シアノ、C₁~C₃アルキル、C₁~C₃ハロアルキル及びC₃~C₄シクロアルキルから独立して選択される1個以上の置換基で任意に置換されていてもよい、請求項1、2、3、4、5又は6のいずれか一項に記載の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくはN - オキシド。

40

【請求項8】

R₁が、水素、フルオロ、クロロ又はメチルであり；R₂が、水素、クロロ又はフルオロであり；R₃がメチルであり、かつR₄が水素であるか；又はR₃が水素であり、かつR₄がメチルであるか；又はR₃が水素であり、かつR₄が水素であり；R₅が、C₁~C₄アルキル、C₂~C₃アルケニル、シクロプロピル又はシクロブチルであり、ここで、前記アルキル、アルケニル、シクロプロピル及びシクロブチルは、フルオロ及びクロロから独立して選択される1~3個の置換基又は1個のメチル基で任意に置換されていてもよく；R₆が、

50

水素、フルオロ、クロロ又はメチルである、請求項 1、2、3、4、5、6 又は 7 のいずれか一項に記載の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシド。

【請求項 9】

R₇が、チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル（ここで、環員メチレン基のうちの 1 つは、C = CF₂を任意に表し得る）、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピリダジニル又はピリジニルであり、ここで、前記チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピリダジニル及びピリジニルは、フルオロ、クロロ、メチル、トリフルオロメチル及びシクロプロピルから独立して選択される 1 個又は 2 個の置換基で任意に置換されていてもよい、請求項 1、2、3、4、5、6、7 又は 8 のいずれか一項に記載の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシド。

10

【請求項 10】

X が、O 又は S であり；R₁が、水素、フルオロ、クロロ又はメチルであり；R₂が、水素、クロロ又はフルオロであり；R₃がメチルであり、かつ R₄が水素であるか；又は R₃が水素であり、かつ R₄がメチルであるか；又は R₃が水素であり、かつ R₄が水素であり；R₅が、C₁ ~ C₄アルキル、C₂ ~ C₃アルケニル、シクロプロピル又はシクロブチルであり、ここで、前記アルキル、アルケニル、シクロプロピル及びシクロブチルは、フルオロ及びクロロから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基又は 1 個のメチル基で任意に置換されていてもよく；R₆が、水素、フルオロ、クロロ又はメチルであり；R₇が、チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル（ここで、環員メチレン基のうちの 1 つは、C = CF₂を任意に表し得る）、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピリダジニル又はピリジニルであり、ここで、前記チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピリダジニル及びピリジニルは、フルオロ、クロロ、メチル、トリフルオロメチル及びシクロプロピルから独立して選択される 1 個又は 2 個の置換基で任意に置換されていてもよい、請求項 1 に記載の化合物；又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシド。

20

30

【請求項 11】

X が、O 又は S であり；R₁が、フルオロ、クロロ又はメチルであり；R₂が、水素又はフルオロであり；R₃及び R₄が共に水素であり；R₅は、トリフルオロメチル、エチル、イソプロピル、tert - ブチル、C₂ - アルケニル又はシクロプロピルであり、ここで、前記エチル、イソプロピル、アルケニル及びシクロプロピルは、フルオロ及びクロロから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基又は 1 個のメチル基で任意に置換されていてもよく；R₆が、メチルであり；R₇が、チエニル、アゼチジニル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル（ここで、環員メチレン基のうちの 1 つは、C = CF₂を任意に表し得る）又はピリジニルであり、ここで、前記チエニル、アゼチジニル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル、及びピリジニルは、フルオロ、クロロ、メチル又はトリフルオロメチルから独立して選択される 1 個又は 2 個の置換基で任意に置換されていてもよい、請求項 1 に記載の化合物；又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシド。

40

【請求項 12】

X が O である、請求項 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10 又は 11 のいずれか一項に記載の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシド。

【請求項 13】

殺菌・殺力比的に有効な量の請求項 1 ~ 12 のいずれかに定義されている式 (I) の化合物を含む組成物。

50

【請求項 1 4】

少なくとも 1 種の追加の有効成分及び / 又は希釈剤をさらに含む、請求項 1 3 に記載の組成物。

【請求項 1 5】

植物病原性真菌の駆除、予防又は防除方法であって、植物病原性真菌、前記植物病原性真菌の生息地、又は、植物病原性真菌による被害を受けやすい植物、又は、その繁殖体に、殺菌・殺カビ的に有効な量の請求項 1 ~ 1 2 のいずれかに定義されている式 (I) の化合物、又は、殺菌・殺カビ的に有効な量の請求項 1 ~ 1 2 のいずれかに定義されている式 (I) の化合物を含む組成物を適用する工程を含む、方法 (ただし、ヒトに適用される方法を除く)。

10

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0 0 0 1】

本発明は、例えば、特に殺菌・殺カビ (fungicidal) 活性といった殺微生物活性を有する有効成分としての殺微生物性キノリン (チオ) カルボキサミド誘導体に関する。本発明はまた、これらのキノリン (チオ) カルボキサミド誘導体の調製、これらのキノリン (チオ) カルボキサミド誘導体の調製に有用な中間体、これらの中間体の調製、少なくとも 1 種のキノリン (チオ) カルボキサミド誘導体を含む農芸化学組成物、これらの組成物の調製、及び、農業又は園芸における、植物、収穫された食品作物、種子又は非生体材料に対する特に真菌といった植物病原性微生物による外寄生を防除若しくは予防するためのキノリン (チオ) カルボキサミド誘導体又は組成物の使用に関する。

20

【背景技術】

【0 0 0 2】

一定の殺菌・殺カビキノリン (チオ) カルボキサミド化合物が国際公開第 0 4 0 3 9 7 8 3 号パンフレットに記載されている。

【0 0 0 3】

意外なことに、一定の新規キノリン (チオ) カルボキサミド誘導体が有利な殺菌・殺カビ特性を有することがここに見いだされた。

【発明の概要】

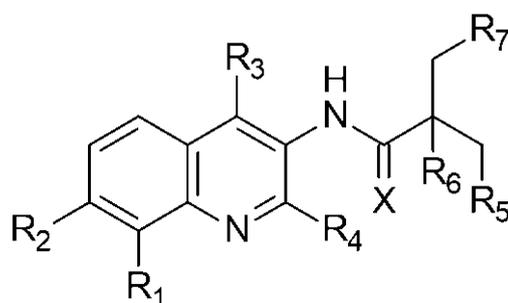
【課題を解決するための手段】

30

【0 0 0 4】

本発明は従って、式 (I) の化合物

【化 1】



40

(I)

(式中、

X は O 又は S であり；

R₁ は、水素、ハロゲン、メチル又はシアノであり；

R₂ は、水素、メチル又はハロゲンであり；

R₃ 及び R₄ は各々、水素、ハロゲン及びメチルから独立して選択され；

R₅ は、C₁ ~ C₄ アルキル、C₂ ~ C₄ アルケニル又は C₃ ~ C₆ シクロアルキルであり、

50

ここで、アルキル、アルケニル及びシクロアルキルは、任意選択により、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $C_1 \sim C_3$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく；

R_6 は、水素、フルオロ、クロロ、シアノ又は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R_7 は、 $C_4 \sim C_{10}$ 飽和若しくは部分不飽和複素環又はヘテロアリアルであり、ここで、複素環又はヘテロアリアルは、N、O及びSから選択される1個、2個又は3個のヘテロ原子を含有し、炭素又は窒素原子を介して結合され、任意選択により、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルチオ及び $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルから独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよい)；
並びにその塩、鏡像異性体及びノ又はN-オキシドを提供する。

10

【発明を実施するための形態】

【0005】

第2の態様において、本発明は、式(I)の化合物を含む農芸化学組成物を提供する。

【0006】

式(I)の化合物は植物病原性微生物の防除に用いられ得る。それ故、植物病原体を防除するために、本発明に係る式(I)の化合物又は式(I)の化合物を含む組成物は、植物病原体に直接、又は、植物病原体の生息地(特に植物病原体による被害を受けやすい植物)に適用され得る。

【0007】

それ故、第3の態様において、本発明は、植物病原体を防除するための本明細書に記載の式(I)の化合物又は式(I)の化合物を含む組成物の使用を提供する。

20

【0008】

さらなる態様において、本発明は、本明細書に記載の式(I)の化合物又は式(I)の化合物を含む組成物を、前記植物病原体、又は、前記植物病原体の生息地(特に植物病原体による被害を受けやすい植物)に適用するステップを含む植物病原体の防除方法を提供する。

【0009】

式(I)の化合物は、植物病原性真菌の防除に特に効果的である。

【0010】

それ故、さらなる態様において、本発明は、植物病原性真菌を防除するための本明細書に記載の式(I)の化合物又は式(I)の化合物を含む組成物の使用を提供する。

30

【0011】

さらなる態様において、本発明は、本明細書に記載の式(I)の化合物又は式(I)の化合物を含む組成物を、前記植物病原性真菌、又は、前記植物病原性真菌の生息地(特に植物病原性真菌による被害を受けやすい植物)に適用するステップを含む植物病原性真菌の防除方法を提供する。

【0012】

置換基が任意選択により置換されていると示されている場合、これは、これらの置換基が、1個以上の同等若しくは異なる置換基、例えば1～4個の置換基を有していてもいなくてもよいことを意味する。通常、3個以下のこのような任意選択の置換基が同時に存在する。好ましくは、2個以下のこのような任意選択の置換基が同時に存在する(すなわち、基は、「任意選択」と記載されている1又は2個の置換基によって任意選択により置換されていてもよい)。「任意選択の置換基」が、シクロアルキル又はフェニルなどの大きな基である場合、1個のこのような任意選択の置換基のみが存在していることが最も好ましい。1個の基が置換されていると示されている場合(例えばアルキル)、これは、他の基の一部であるこれらの基を含む(例えばアルキルチオ中のアルキル)。

40

【0013】

「ハロゲン」という用語は、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素を指し、好ましくはフッ素、塩素又は臭素を指す。

50

【0014】

アルキル置換基（単独で、又は、アルコキシ -、アルキルチオ - などのより大きな基の一部として）は、直鎖又は分岐であり得る。アルキルそれ自体、又は、他の置換基の一部としてのアルキルは、言及されている炭素原子の数に応じて、例えば、メチル、エチル、*n* - プロピル、*n* - ブチル、*n* - ペンチル、*n* - ヘキシル及びその異性体、例えば、イソ - プロピル、イソ - ブチル、*sec* - ブチル、*t* - ブチル又はイソ - アミルである。

【0015】

アルケニル置換基（単独で、又は、例えばアルケニルオキシといったより大きな基の一部として）は、直鎖又は分岐鎖の形態であることが可能であり、及び、適切な場合、アルケニル部分は、（*E*）又は（*Z*）立体配置のいずれかであることが可能である。例はビニル及びアリルである。アルケニル基は、好ましくは $C_2 \sim C_6$ 、より好ましくは $C_2 \sim C_4$ 、最も好ましくは $C_2 \sim C_3$ アルケニル基である。

10

【0016】

アルキニル置換基（単独で、又は、例えばアルキニルオキシといったより大きな基の一部として）は、直鎖又は分岐鎖の形態であることが可能である。例は、エチニル及びプロパルギルである。アルキニル基は、好ましくは $C_2 \sim C_6$ 、より好ましくは、 $C_2 \sim C_4$ 、最も好ましくは $C_2 \sim C_3$ アルキニル基である。

【0017】

シクロアルキル置換基は、飽和若しくは部分不飽和、好ましくは完全飽和であり得、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルである。

20

【0018】

ハロアルキル基（単独で、又は、例えばハロアルキルオキシといったより大きな基の一部として）は、1個以上の同等又は異なるハロゲン原子を含有していてもよく、例えば、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_3CH_2 、 CH_3CF_2 、 CF_3CF_2 又は CCl_3CCl_2 を指していてもよい。

【0019】

ハロアルケニル基（単独で、又は、例えばハロアルケニルオキシといったより大きな基の一部として）は、それぞれアルケニル基であり、これらは、1個以上の同一又は異なるハロゲン原子で置換されており、例えば、2, 2 - ジフルオロビニル又は1, 2 - ジクロロ - 2 - フルオロ - ビニルである。

30

【0020】

ハロアルキニル基（単独で、又は、例えばハロアルキニルオキシといったより大きな基の一部として）は、それぞれアルキニル基であり、これらは、1個以上の同一又は異なるハロゲン原子で置換されており、例えば、1 - クロロ - プロブ - 2 - イニルである。

【0021】

アルコキシはラジカル - ORを意味し、式中、例えば上記に定義されているとおり、Rはアルキルである。アルコキシ基としては、これらに限定されないが、メトキシ、エトキシ、1 - メチルエトキシ、プロポキシ、ブトキシ、1 - メチルプロポキシ及び2 - メチルプロポキシが挙げられる。

【0022】

シアノは - CN基を意味する。

40

【0023】

アミノは - NH₂基を意味する。

【0024】

ヒドロキシル又はヒドロキシは、 - OH基を指す。

【0025】

アリール基（単独で、又は、例えばアリールオキシ、アリール - アルキルなどのより大きな基の一部として）は、単環式、二環式又は三環式の形態であることが可能である芳香族環系である。このような環の例としては、フェニル、ナフチル、アントラセニル、インデニル又はフェナントレニルが挙げられる。好ましいアリール基はフェニル及びナフチル

50

であり、フェニルが最も好ましい。アリール部分が置換されていると言われる場合、このアリール部分は、好ましくは1～4個の置換基、最も好ましくは1～3個の置換基で置換されている。

【0026】

ヘテロアリール基（単独で、又は、例えばヘテロアリールオキシ、ヘテロアリール-アルキルなどのより大きな基の一部として）は、少なくとも1個のヘテロ原子を含有すると共に、単一の環又は2つ以上の縮合環から構成される芳香族環系である。好ましくは、単一の環は3個以下のヘテロ原子を含有し、二環系は4個以下のヘテロ原子を含有することとなり、これらは、窒素、酸素及び硫黄から好ましく選択されることとなる。単環式基の例としては、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル（例えば[1, 2, 4]トリアゾリル）、フラニル、チオフェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル及びチアジアゾリルが挙げられる。二環式基の例としては、プリニル、キノリニル、シノリニル、キノキサリニル、インドリル、インダゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾチオフェニル及びベンゾチアゾリルが挙げられる。単環式ヘテロアリール基が好ましく、ピリジルが最も好ましい。ヘテロアリール部分が置換されていると言われる場合、このヘテロアリール部分は、好ましくは1～4個の置換基、最も好ましくは1～3個の置換基で置換されている。

10

【0027】

ヘテロシクリル基、複素環又は複素環（単独で、又は、ヘテロシクリル-アルキルなどのより大きな基の一部として）は、O、S及びNから選択される1個以上（好ましくは1個、2個又は3個）のヘテロ原子を含む10個以下の原子を含有する非芳香族環構造である。単環式基の例としては、オキセタニル、4, 5-ジヒドロ-イソオキサゾリル、チエタニル、ピロリジニル、テトラヒドロフラニル、[1, 3]ジオキサニル、ペペリジニル、ピペラジニル、[1, 4]ジオキサニル、イミダゾリジニル、[1, 3, 5]オキサジアジナニル、ヘキサヒドロ-ピリミジニル、[1, 3, 5]トリアジナニル及びモルホリニル、又は、1-オキソ-チエタニル及び1, 1-ジオキソ-チエタニルなどのこれらの酸化型が挙げられる。二環式基の例としては、2, 3-ジヒドロ-ベンゾフラニル、ベンゾ[1, 4]ジオキサニル、ベンゾ[1, 3]ジオキサニル、クロメニル及び2, 3-ジヒドロ-ベンゾ[1, 4]ジオキシニルが挙げられる。ヘテロシクリル部分が置換されていると言われる場合、このヘテロシクリル部分は、好ましくは1～4個の置換基、最も好ましくは1～3個の置換基で置換されている。

20

30

【0028】

式(I)の化合物中に1個以上の不斉炭素原子の存在が可能であるとは、その化合物が光学異性形態、すなわち、鏡像異性形態又はジアステレオ異性形態をとり得ることを意味する。また、単結合に係る回転の制限によってアストロプ異性体が生じ得る。式(I)は、すべてのこれらの可能性のある異性形態及びその混合物を含むことが意図されている。本発明は、式(I)の化合物に係るすべてのこれらの可能性のある異性形態及びその混合物を含む。同様に、式(I)は、すべての可能性のある互変異性体を含むことが意図されている。本発明は、式(I)の化合物に係るすべての可能性のある互変異性形態を含む。

40

【0029】

各事例において、本発明に係る式(I)の化合物は、遊離形態、N-オキシドとしての酸化型、又は、例えば農業経済学的に使用可能な塩形態といった塩形態である。

【0030】

N-オキシドは、第三級アミンの酸化型、又は、窒素含有芳香族複素環式化合物の酸化型である。これらは、例えば、書籍“Heterocyclic N-oxides”, A. Albin and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991に記載されている。

【0031】

X、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆及びR₇の好ましい値は、いずれかのこれらの組み

50

合わせで、以下に記載されているとおりである。

【 0 0 3 2 】

好ましくは、XはOである。

【 0 0 3 3 】

好ましくは、R₁は、水素、フルオロ、クロロ、メチル又はシアノである。

【 0 0 3 4 】

より好ましくは、R₁は、水素、フルオロ、クロロ又はメチルである。

【 0 0 3 5 】

最も好ましくは、R₁はフルオロ、クロロ又はメチルである。

【 0 0 3 6 】

好ましくは、R₂は、水素、メチル、クロロ又はフルオロである。

【 0 0 3 7 】

より好ましくは、R₂は水素、クロロ又はフルオロである。

【 0 0 3 8 】

最も好ましくは、R₂は水素、フルオロである。

【 0 0 3 9 】

好ましくは、R₃及びR₄は各々、水素及びメチルから独立して選択される。

【 0 0 4 0 】

より好ましくは、R₃はメチルであると共にR₄は水素であり；又は、R₃は水素であると共にR₄はメチルであり；又は、R₃は水素であると共にR₄は水素である。

【 0 0 4 1 】

最も好ましくは、R₃及びR₄は共に水素である。

【 0 0 4 2 】

好ましくは、R₅は、C₁~C₄アルキル、C₂~C₄アルケニル又はC₃~C₆シクロアルキルであり、ここで、アルキル、アルケニル及びシクロアルキルは、任意選択により、フルオロ、クロロ及びC₁~C₃アルキルから独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい。

【 0 0 4 3 】

より好ましくは、R₅は、C₁~C₄アルキル、C₂~C₃アルケニル、シクロプロピル又はシクロブチルであり、ここで、アルキル、アルケニル、シクロプロピル及びシクロブチルは、任意選択により、フルオロ及びクロロ又は1個のメチル基から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい。

【 0 0 4 4 】

最も好ましくは、R₅は、トリフルオロメチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル、C₂-アルケニル又はシクロプロピルであり、ここで、エチル、イソプロピル、アルケニル及びシクロプロピルは、任意選択により、フルオロ及びクロロ又は1個のメチル基から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい。

【 0 0 4 5 】

好ましくは、R₆は水素、フルオロ、クロロ又はC₁~C₃アルキルである。

【 0 0 4 6 】

より好ましくは、R₆は、水素、フルオロ、クロロ又はメチルである。

【 0 0 4 7 】

最も好ましくは、R₆はメチルである。

【 0 0 4 8 】

好ましくは、R₇は、チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル(ここで、環員メチレン基のうち1つは、任意選択により、C=O、C=CH₂又はC=CF₂を表し得る)、ピリダジニル、オキサジナニル(oxazinanyl)、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4,5-ジヒドロ-3H-ピリダジニル又はピリジニルであり、ここで、チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル

10

20

30

40

50

、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル、ピリダジニル、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピリダジニル及びピリジニルは、任意選択により、フルオロ、クロロ、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ 八口アルキル及び $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルから独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよい。

【0049】

より好ましくは、 R_7 は、チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル（ここで、環員メチレン基のうちの一つは、任意選択により、 $C = CF_2$ を表し得る）、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピリダジニル又はピリジニルであり、ここで、チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピリダジニル及びピリジニルは、任意選択により、フルオロ、クロロ、メチル、トリフルオロメチル及びシクロプロピルから独立して選択される1個又は2個の置換基で置換されていてもよい。

10

【0050】

さらにより好ましくは、 R_7 は、チエニル、アゼチジニル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル（ここで、環員メチレン基のうちの一つは、任意選択により、 $C = CF_2$ を表し得る）又はピリジニルであり、ここで、チエニル、アゼチジニル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル、及びピリジニルは、任意選択により、フルオロ、クロロ、メチル又はトリフルオロメチルから独立して選択される1個又は2個の置換基で置換されていてもよい。

20

【0051】

最も好ましくは、 R_7 は、チエニル、チアゾリル又はピペリジル（ここで、環員メチレン基のうちの一つは、任意選択により、 $C = CF_2$ を表し得る）であり、ここで、チエニル、チアゾリル及びピペリジルは、任意選択により、フルオロ、クロロ、メチル又はトリフルオロメチルから独立して選択される1個又は2個の置換基で置換されていてもよい。

【0052】

本発明に係る実施形態は、以下に記載されているとおり提供されている。

30

【0053】

実施形態1は、上記に定義されている式(I)の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくはN - オキシドを提供する。

【0054】

実施形態2は、 R_1 が、水素、フルオロ、クロロ、メチル又はシアノである、実施形態1に係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくはN - オキシドを提供する。

【0055】

実施形態3は、 R_2 が、水素、メチル、クロロ又はフルオロである、実施形態1若しくは2に係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくはN - オキシドを提供する。

【0056】

実施形態4は、 R_3 及び R_4 が各々、水素及びメチルから独立して選択される、実施形態1、2若しくは3のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくはN - オキシドを提供する。

40

【0057】

実施形態5は、 R_5 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、ここで、アルキル、アルケニル及びシクロアルキルは、任意選択により、フルオロ、クロロ及び $C_1 \sim C_3$ アルキルから独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい、実施形態1、2、3若しくは4のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくはN - オキシドを提供する。

【0058】

50

実施形態 6 は、 R_6 が水素、フルオロ、クロロ又は $C_1 \sim C_3$ アルキルである、実施形態 1、2、3、4、若しくは 5 のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシドを提供する。

【0059】

実施形態 7 は、 R_7 が、チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル（ここで、環員メチレン基のうちの一つは、任意選択により、 $C = O$ 、 $C = CH_2$ 又は $C = CF_2$ を表し得る）、ピリダジニル、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピリダジニル又はピリジニルであり、ここで、チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル、ピリダジニル、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピリダジニル及びピリジニルは、任意選択により、フルオロ、クロロ、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル及び $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルから独立して選択される 1 個以上の置換基で置換されていてもよい、実施形態 1、2、3、4、5、若しくは 6 のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシドを提供する。

10

【0060】

実施形態 8 は、 R_1 が、水素、フルオロ、クロロ又はメチルである、実施形態 1、2、3、4、5、6、若しくは 7 のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシドを提供する。

20

【0061】

実施形態 9 は、 R_2 が、水素、クロロ又はフルオロである、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、若しくは 8 のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシドを提供する。

【0062】

実施形態 10 は、 R_3 がメチルであると共に R_4 が水素であり；又は R_3 が水素であると共に R_4 がメチルであり；又は R_3 が水素であると共に R_4 が水素である、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、若しくは 9 のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシドを提供する。

【0063】

実施形態 11 は、 R_5 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルケニル、シクロプロピル又はシクロブチルであり、ここで、アルキル、アルケニル、シクロプロピル及びシクロブチルは、任意選択により、フルオロ及びクロロ又は 1 個のメチル基から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9 若しくは 10 のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシドを提供する。

30

【0064】

実施形態 12 は、 R_6 が、水素、フルオロ、クロロ又はメチルである、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10 若しくは 11 のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシドを提供する。

40

【0065】

実施形態 13 は、 R_7 が、チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル（ここで、環員メチレン基のうちの一つは、任意選択により、 $C = CF_2$ を表し得る）、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピリダジニル又はピリジニルであり、ここで、チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピリダジニル及びピリジニルは、任意選択により、フルオロ、クロロ、メチル、トリフルオロメチル及びシクロプロピルから独立して選択される 1 個又は 2 個の置換基で置換されていてもよ

50

い、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11 若しくは 12 のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシドを提供する。

【0066】

実施形態 14 は、 R_1 が、フルオロ、クロロ又はメチルである、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12 若しくは 13 のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシドを提供する。

【0067】

実施形態 15 は、 R_2 が水素又はフルオロである、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13 若しくは 14 のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシドを提供する。

【0068】

実施形態 16 は、 R_3 及び R_4 が共に水素である、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14 若しくは 15 のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシドを提供する。

【0069】

実施形態 17 は、 R_5 が、トリフルオロメチル、エチル、イソプロピル、tert - ブチル、 C_2 - アルケニル又はシクロプロピルであり、ここで、エチル、イソプロピル、アルケニル及びシクロプロピルは、任意選択により、フルオロ及びクロロ又は 1 個のメチル基から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15 若しくは 16 のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシドを提供する。

【0070】

実施形態 18 は、 R_6 がメチルである、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16 若しくは 17 のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシドを提供する。

【0071】

実施形態 19 は、 R_7 が、チエニル、アゼチジニル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル（ここで、環員メチレン基のうちの 1 つは、任意選択により、 $C = CF_2$ を表し得る）又はピリジニルであり、ここで、チエニル、アゼチジニル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル、及びピリジニルは、任意選択により、フルオロ、クロロ、メチル又はトリフルオロメチルから独立して選択される 1 個又は 2 個の置換基で置換されていてもよい、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17 若しくは 18 のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシドを提供する。

【0072】

実施形態 20 は、 R_7 が、チエニル、チアゾリル又はピペリジル（ここで、環員メチレン基のうちの 1 つは、任意選択により、 $C = CF_2$ を表し得る）であり、ここで、チエニル、チアゾリル及びピペリジルは、任意選択により、フルオロ、クロロ、メチル又はトリフルオロメチルから独立して選択される 1 個又は 2 個の置換基で置換されていてもよい、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18 若しくは 19 のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシドを提供する。

【0073】

実施形態 21 は、X が O である、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19 若しくは 20 のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシドを提供する。

【0074】

実施形態 22 は、X が S である、実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19 若しくは 20 のいずれか一つに係る化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシドを提供する。

10

20

30

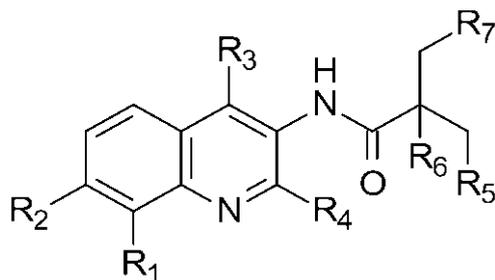
40

50

【 0 0 7 5 】

本発明に係る化合物の一群は、式 (I ') のもの :

【 化 2 】



(I')

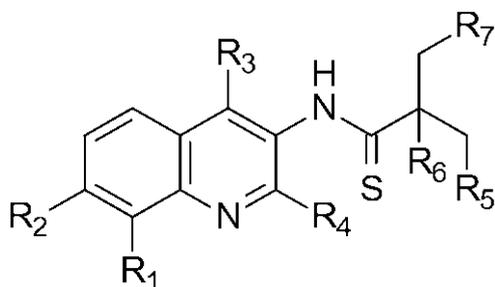
10

(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 及び R_7 は、式 (I) の化合物について定義されているとおりである)、又は、その塩、鏡像異性体若しくはN - オキドである。 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 及び R_7 の好ましい定義は、式 (I) の化合物について定義されているとおりである。

【 0 0 7 6 】

本発明に係る化合物の一群は、式 (I '') のもの :

【 化 3 】



(I'')

20

30

(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 及び R_7 は、式 (I) の化合物について定義されているとおりである)、又は、その塩、鏡像異性体若しくはN - オキドである。 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 及び R_7 の好ましい定義は、式 (I) の化合物について定義されているとおりである。

【 0 0 7 7 】

本発明に係る化合物の好ましい群は、XがO又はSであり； R_1 が、水素、フルオロ、クロロ、メチル又はシアノであり； R_2 が、水素、メチル、クロロ又はフルオロであり； R_3 及び R_4 が各々、水素及びメチルから独立して選択され； R_5 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、ここで、アルキル、アルケニル及びシクロアルキルは、任意選択により、フルオロ、クロロ及び $C_1 \sim C_3$ アルキルから独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく； R_6 が水素、フルオロ、クロロ又は $C_1 \sim C_3$ アルキルであり； R_7 が、チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル (ここで、環員メチレン基のうちの一つは、任意選択により、 $C=O$ 、 $C=CH_2$ 又は $C=CF_2$ を表し得る)、ピリダジニル、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3H - ピリダジニル又はピリジニルであり、ここで、チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル、ピリダジニル、オキサジナニル、チオモルホリニル、

40

50

モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピリダジニル及びピリジニルは、任意選択により、フルオロ、クロロ、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル及び $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルから独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよい式(I)の化合物である、式(I-1)のもの；又はその塩、鏡像異性体若しくはN - オキシドである。

【0078】

本実施形態に係る化合物の一群は、XがOである式(I-1)の化合物である、式(I-1a)の化合物である。

【0079】

本実施形態に係る化合物の他の群は、XがSである式(I-1)の化合物である、式(I-1b)の化合物である。

10

【0080】

本発明に係る化合物のさらに好ましい群は、XがO又はSであり； R_1 が、水素、フルオロ、クロロ又はメチルであり； R_2 が、水素、クロロ又はフルオロであり； R_3 がメチルであると共に R_4 が水素であり；又は R_3 が水素であると共に R_4 がメチルであり；又は R_3 が水素であると共に R_4 が水素であり； R_5 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルケニル、シクロプロピル又はシクロブチルであり、ここで、アルキル、アルケニル、シクロプロピル及びシクロブチルは、任意選択により、フルオロ及びクロロ又は1個のメチル基から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく； R_6 が、水素、フルオロ、クロロ又はメチルであり； R_7 が、チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル(ここで、環員メチレン基のうち1つは、任意選択により、 $C = CF_2$ を表し得る)、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピリダジニル又はピリジニルであり、ここで、チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピリダジニル及びピリジニルは、任意選択により、フルオロ、クロロ、メチル、トリフルオロメチル及びシクロプロピルから独立して選択される1個又は2個の置換基で置換されていてもよい式(I)の化合物である、式(I-2)のもの；又はその塩、鏡像異性体若しくはN - オキシドである。

20

30

【0081】

本実施形態に係る化合物の一群は、XがOである式(I-2)の化合物である、式(I-2a)の化合物である。

【0082】

本実施形態に係る化合物の他の群は、XがSである式(I-2)の化合物である、式(I-2b)の化合物である。

【0083】

本発明に係る化合物のさらに好ましい群は、XがO又はSであり； R_1 が、フルオロ、クロロ又はメチルであり； R_2 が水素又はフルオロであり； R_3 及び R_4 が共に水素であり； R_5 は、トリフルオロメチル、エチル、イソプロピル、tert - ブチル、 C_2 - アルケニル又はシクロプロピルであり、ここで、エチル、イソプロピル、アルケニル及びシクロプロピルは、任意選択により、フルオロ及びクロロ又は1個のメチル基から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく； R_6 はメチルであり； R_7 は、チエニル、アゼチジニル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル(ここで、環員メチレン基のうち1つは、任意選択により、 $C = CF_2$ を表し得る)又はピリジニルであり、ここで、チエニル、アゼチジニル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル、及びピリジニルは、任意選択により、フルオロ、クロロ、メチル又はトリフルオロメチルから独立して選択される1個又は2個の置換基で置換されていてもよい式(I)の化合物である、式(I-3)のもの；又はその塩、鏡像異性体若しくはN - オキシドである。

40

【0084】

50

本実施形態に係る化合物の一群は、XがOである式(I-3)の化合物である、式(I-3a)の化合物である。

【0085】

本実施形態に係る化合物の他の群は、XがSである式(I-3)の化合物である、式(I-3b)の化合物である。

【0086】

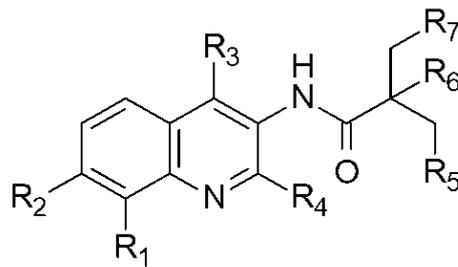
本発明に係る化合物は、とりわけ、真菌によって引き起こされる病害に対する植物の保護に係る有利なレベルの生物学的活性、又は、農芸化学有効成分としての使用に係る優れた特性(例えば、高い生物学的活性、有利な活性スペクトル、高い安全プロファイル、向上した物理化学的特性又は高い生分解性)を含む、多数の有益性を有し得る。

10

【0087】

式(I)の化合物の特定の例が以下の表A1~A8に例示されており：表A1は、360種の式(I-a)の化合物

【化4】



20

(I-a)

を提供し、式中、R₁、R₂、R₃及びR₄はすべてHであり、並びに、式中、R₅、R₆及びR₇の値は以下の表Zに定義されているとおりである。

【0088】

30

40

50

【表 1 - 1】

表 Z

項目	R ₅	R ₆	R ₇
1	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	2-チエニル
2	CH ₂ CF ₃	H	2-チエニル
3	CH ₂ シクロプロピル	H	2-チエニル
4	CH ₂ C(CH ₃) ₃	H	2-チエニル
5	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	3-チエニル
6	CH ₂ CF ₃	H	3-チエニル
7	CH ₂ シクロプロピル	H	3-チエニル
8	CH ₂ C(CH ₃) ₃	H	3-チエニル
9	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	5-F-2-チエニル
10	CH ₂ CF ₃	H	5-F-2-チエニル
11	CH ₂ シクロプロピル	H	5-F-2-チエニル
12	CH ₂ C(CH ₃) ₃	H	5-F-2-チエニル
13	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	5-F-3-チエニル
14	CH ₂ CF ₃	H	5-F-3-チエニル
15	CH ₂ シクロプロピル	H	5-F-3-チエニル
16	CH ₂ C(CH ₃) ₃	H	5-F-3-チエニル
17	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	5-Cl-2-チエニル
18	CH ₂ CF ₃	H	5-Cl-2-チエニル
19	CH ₂ シクロプロピル	H	5-Cl-2-チエニル
20	CH ₂ C(CH ₃) ₃	H	5-Cl-2-チエニル
21	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	5-Cl-3-チエニル
22	CH ₂ CF ₃	H	5-Cl-3-チエニル
23	CH ₂ シクロプロピル	H	5-Cl-3-チエニル
24	CH ₂ C(CH ₃) ₃	H	5-Cl-3-チエニル
25	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
26	CH ₂ CF ₃	H	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
27	CH ₂ シクロプロピル	H	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
28	CH ₂ C(CH ₃) ₃	H	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
29	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
30	CH ₂ CF ₃	H	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
31	CH ₂ シクロプロピル	H	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
32	CH ₂ C(CH ₃) ₃	H	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
33	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	3,3-ジフルオロ-1-ペリジニル
34	CH ₂ CF ₃	H	3,3-ジフルオロ-1-ペリジニル
35	CH ₂ シクロプロピル	H	3,3-ジフルオロ-1-ペリジニル

10

20

30

40

50

【表 1 - 2】

36	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	H	3,3-ジフルオロ-1-ピペリジル
37	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	F	2-チエニル
38	CH_2CF_3	F	2-チエニル
39	CH_2 シクロプロピル	F	2-チエニル
40	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	F	2-チエニル
41	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	F	3-チエニル
42	CH_2CF_3	F	3-チエニル
43	CH_2 シクロプロピル	F	3-チエニル
44	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	F	3-チエニル
45	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	F	5-F-2-チエニル
46	CH_2CF_3	F	5-F-2-チエニル
47	CH_2 シクロプロピル	F	5-F-2-チエニル
48	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	F	5-F-2-チエニル
49	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	F	5-F-3-チエニル
50	CH_2CF_3	F	5-F-3-チエニル
51	CH_2 シクロプロピル	F	5-F-3-チエニル
52	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	F	5-F-3-チエニル
53	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	F	5-Cl-2-チエニル
54	CH_2CF_3	F	5-Cl-2-チエニル
55	CH_2 シクロプロピル	F	5-Cl-2-チエニル
56	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	F	5-Cl-2-チエニル
57	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	F	5-Cl-3-チエニル
58	CH_2CF_3	F	5-Cl-3-チエニル
59	CH_2 シクロプロピル	F	5-Cl-3-チエニル
60	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	F	5-Cl-3-チエニル
61	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	F	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
62	CH_2CF_3	F	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
63	CH_2 シクロプロピル	F	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
64	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	F	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
65	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	F	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
66	CH_2CF_3	F	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
67	CH_2 シクロプロピル	F	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
68	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	F	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
69	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	F	3,3-ジフルオロ-1-ピペリジル
70	CH_2CF_3	F	3,3-ジフルオロ-1-ピペリジル
71	CH_2 シクロプロピル	F	3,3-ジフルオロ-1-ピペリジル
72	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	F	3,3-ジフルオロ-1-ピペリジル

10

20

30

40

50

【表 1 - 3】

73	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	2-チエニル
74	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	2-チエニル
75	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	2-チエニル
76	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	2-チエニル
77	CF_3	CH_3	2-チエニル
78	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	2-チエニル
79	シクロプロピル	CH_3	2-チエニル
80	1-メチルシクロプロピル	CH_3	2-チエニル
81	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	2-チエニル
82	1-シアノシクロプロピル	CH_3	2-チエニル
83	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	2-チエニル
84	CF_2CH_3	CH_3	2-チエニル
85	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	3-チエニル
86	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	3-チエニル
87	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	3-チエニル
88	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	3-チエニル
89	CF_3	CH_3	3-チエニル
90	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	3-チエニル
91	シクロプロピル	CH_3	3-チエニル
92	1-メチルシクロプロピル	CH_3	3-チエニル
93	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	3-チエニル
94	1-シアノシクロプロピル	CH_3	3-チエニル
95	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	3-チエニル
96	CF_2CH_3	CH_3	3-チエニル
97	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	5-F-2-チエニル
98	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	5-F-2-チエニル
99	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	5-F-2-チエニル
100	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	5-F-2-チエニル
101	CF_3	CH_3	5-F-2-チエニル
102	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	5-F-2-チエニル
103	シクロプロピル	CH_3	5-F-2-チエニル
104	1-メチルシクロプロピル	CH_3	5-F-2-チエニル
105	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	5-F-2-チエニル
106	1-シアノシクロプロピル	CH_3	5-F-2-チエニル
107	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	5-F-2-チエニル
108	CF_2CH_3	CH_3	5-F-2-チエニル

10

20

30

40

50

【表 1 - 4】

109	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	5-F-3-チエニル
110	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	5-F-3-チエニル
111	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	5-F-3-チエニル
112	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	5-F-3-チエニル
113	CF_3	CH_3	5-F-3-チエニル
114	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	5-F-3-チエニル
115	シクロプロピル	CH_3	5-F-3-チエニル
116	1-メチルシクロプロピル	CH_3	5-F-3-チエニル
117	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	5-F-3-チエニル
118	1-シアノシクロプロピル	CH_3	5-F-3-チエニル
119	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	5-F-3-チエニル
120	CF_2CH_3	CH_3	5-F-3-チエニル
121	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	2-F-3-チエニル
122	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	2-F-3-チエニル
123	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	2-F-3-チエニル
124	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	2-F-3-チエニル
125	CF_3	CH_3	2-F-3-チエニル
126	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	2-F-3-チエニル
127	シクロプロピル	CH_3	2-F-3-チエニル
128	1-メチルシクロプロピル	CH_3	2-F-3-チエニル
129	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	2-F-3-チエニル
130	1-シアノシクロプロピル	CH_3	2-F-3-チエニル
131	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	2-F-3-チエニル
132	CF_2CH_3	CH_3	2-F-3-チエニル
133	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	2-F-3-チエニル
134	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	2-F-3-チエニル
135	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	2-F-3-チエニル
136	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	2-F-3-チエニル
137	CF_3	CH_3	2-F-3-チエニル
138	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	2-F-3-チエニル
139	シクロプロピル	CH_3	2-F-3-チエニル
140	1-メチルシクロプロピル	CH_3	2-F-3-チエニル
141	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	2-F-3-チエニル
142	1-シアノシクロプロピル	CH_3	2-F-3-チエニル
143	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	2-F-3-チエニル
144	CF_2CH_3	CH_3	2-F-3-チエニル

10

20

30

40

50

【表 1 - 5】

145	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	5-Cl-2-チエニル
146	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	5-Cl-2-チエニル
147	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	5-Cl-2-チエニル
148	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	5-Cl-2-チエニル
149	CF_3	CH_3	5-Cl-2-チエニル
150	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	5-Cl-2-チエニル
151	シクロプロピル	CH_3	5-Cl-2-チエニル
152	1-メチルシクロプロピル	CH_3	5-Cl-2-チエニル
153	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	5-Cl-2-チエニル
154	1-シアノシクロプロピル	CH_3	5-Cl-2-チエニル
155	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	5-Cl-2-チエニル
156	CF_2CH_3	CH_3	5-Cl-2-チエニル
157	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	5-Cl-3-チエニル
158	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	5-Cl-3-チエニル
159	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	5-Cl-3-チエニル
160	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	5-Cl-3-チエニル
161	CF_3	CH_3	5-Cl-3-チエニル
162	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	5-Cl-3-チエニル
163	シクロプロピル	CH_3	5-Cl-3-チエニル
164	1-メチルシクロプロピル	CH_3	5-Cl-3-チエニル
165	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	5-Cl-3-チエニル
166	1-シアノシクロプロピル	CH_3	5-Cl-3-チエニル
167	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	5-Cl-3-チエニル
168	CF_2CH_3	CH_3	5-Cl-3-チエニル
169	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	2-Cl-3-チエニル
170	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	2-Cl-3-チエニル
171	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	2-Cl-3-チエニル
172	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	2-Cl-3-チエニル
173	CF_3	CH_3	2-Cl-3-チエニル
174	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	2-Cl-3-チエニル
175	シクロプロピル	CH_3	2-Cl-3-チエニル
176	1-メチルシクロプロピル	CH_3	2-Cl-3-チエニル
177	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	2-Cl-3-チエニル
178	1-シアノシクロプロピル	CH_3	2-Cl-3-チエニル
179	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	2-Cl-3-チエニル
180	CF_2CH_3	CH_3	2-Cl-3-チエニル

10

20

30

40

50

【表 1 - 6】

181	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	ピラゾール-1-イル
182	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	ピラゾール-1-イル
183	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	ピラゾール-1-イル
184	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	ピラゾール-1-イル
185	CF_3	CH_3	ピラゾール-1-イル
186	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	ピラゾール-1-イル
187	シクロプロピル	CH_3	ピラゾール-1-イル
188	1-メチルシクロプロピル	CH_3	ピラゾール-1-イル
189	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	ピラゾール-1-イル
190	1-シアノシクロプロピル	CH_3	ピラゾール-1-イル
191	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	ピラゾール-1-イル
192	CF_2CH_3	CH_3	ピラゾール-1-イル
193	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	3- CH_3 -ピラゾール-1-イル
194	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	3- CH_3 -ピラゾール-1-イル
195	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	3- CH_3 -ピラゾール-1-イル
196	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	3- CH_3 -ピラゾール-1-イル
197	CF_3	CH_3	3- CH_3 -ピラゾール-1-イル
198	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	3- CH_3 -ピラゾール-1-イル
199	シクロプロピル	CH_3	3- CH_3 -ピラゾール-1-イル
200	1-メチルシクロプロピル	CH_3	3- CH_3 -ピラゾール-1-イル
201	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	3- CH_3 -ピラゾール-1-イル
202	1-シアノシクロプロピル	CH_3	3- CH_3 -ピラゾール-1-イル
203	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	3- CH_3 -ピラゾール-1-イル
204	CF_2CH_3	CH_3	3- CH_3 -ピラゾール-1-イル
205	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	チアゾール-2-イル
206	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	チアゾール-2-イル
207	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	チアゾール-2-イル
208	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	チアゾール-2-イル
209	CF_3	CH_3	チアゾール-2-イル
210	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	チアゾール-2-イル
211	シクロプロピル	CH_3	チアゾール-2-イル
212	1-メチルシクロプロピル	CH_3	チアゾール-2-イル
213	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	チアゾール-2-イル
214	1-シアノシクロプロピル	CH_3	チアゾール-2-イル
215	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	チアゾール-2-イル
216	CF_2CH_3	CH_3	チアゾール-2-イル

10

20

30

40

50

【表 1 - 7】

217	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	チアゾール-4-イル
218	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	チアゾール-4-イル
219	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	チアゾール-4-イル
220	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	チアゾール-4-イル
221	CF_3	CH_3	チアゾール-4-イル
222	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	チアゾール-4-イル
223	シクロプロピル	CH_3	チアゾール-4-イル
224	1-メチルシクロプロピル	CH_3	チアゾール-4-イル
225	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	チアゾール-4-イル
226	1-シアノシクロプロピル	CH_3	チアゾール-4-イル
227	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	チアゾール-4-イル
228	CF_2CH_3	CH_3	チアゾール-4-イル
229	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	チアゾール-5-イル
230	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	チアゾール-5-イル
231	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	チアゾール-5-イル
232	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	チアゾール-5-イル
233	CF_3	CH_3	チアゾール-5-イル
234	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	チアゾール-5-イル
235	シクロプロピル	CH_3	チアゾール-5-イル
236	1-メチルシクロプロピル	CH_3	チアゾール-5-イル
237	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	チアゾール-5-イル
238	1-シアノシクロプロピル	CH_3	チアゾール-5-イル
239	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	チアゾール-5-イル
240	CF_2CH_3	CH_3	チアゾール-5-イル
241	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-4-イル
242	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-4-イル
243	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-4-イル
244	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-4-イル
245	CF_3	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-4-イル
246	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-4-イル
247	シクロプロピル	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-4-イル
248	1-メチルシクロプロピル	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-4-イル
249	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-4-イル
250	1-シアノシクロプロピル	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-4-イル
251	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-4-イル
252	CF_2CH_3	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-4-イル

10

20

30

40

50

【表 1 - 8】

253	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-5-イル
254	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-5-イル
255	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-5-イル
256	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-5-イル
257	CF_3	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-5-イル
258	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-5-イル
259	シクロプロピル	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-5-イル
260	1-メチルシクロプロピル	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-5-イル
261	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-5-イル
262	1-シアノシクロプロピル	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-5-イル
263	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-5-イル
264	CF_2CH_3	CH_3	2- CH_3 -チアゾール-5-イル
265	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	2-Cl-チアゾール-4-イル
266	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	2-Cl-チアゾール-4-イル
267	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	2-Cl-チアゾール-4-イル
268	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	2-Cl-チアゾール-4-イル
269	CF_3	CH_3	2-Cl-チアゾール-4-イル
270	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	2-Cl-チアゾール-4-イル
271	シクロプロピル	CH_3	2-Cl-チアゾール-4-イル
272	1-メチルシクロプロピル	CH_3	2-Cl-チアゾール-4-イル
273	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	2-Cl-チアゾール-4-イル
274	1-シアノシクロプロピル	CH_3	2-Cl-チアゾール-4-イル
275	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	2-Cl-チアゾール-4-イル
276	CF_2CH_3	CH_3	2-Cl-チアゾール-4-イル
277	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	2-Cl-チアゾール-5-イル
278	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	2-Cl-チアゾール-5-イル
279	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	2-Cl-チアゾール-5-イル
280	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	2-Cl-チアゾール-5-イル
281	CF_3	CH_3	2-Cl-チアゾール-5-イル
282	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	2-Cl-チアゾール-5-イル
283	シクロプロピル	CH_3	2-Cl-チアゾール-5-イル
284	1-メチルシクロプロピル	CH_3	2-Cl-チアゾール-5-イル
285	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	2-Cl-チアゾール-5-イル
286	1-シアノシクロプロピル	CH_3	2-Cl-チアゾール-5-イル
287	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	2-Cl-チアゾール-5-イル
288	CF_2CH_3	CH_3	2-Cl-チアゾール-5-イル

10

20

30

40

50

【表 1 - 9】

289	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
290	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
291	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
292	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
293	CF_3	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
294	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
295	シクロプロピル	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
296	1-メチルシクロプロピル	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
297	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
298	1-シアノシクロプロピル	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
299	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
300	CF_2CH_3	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-アゼチジニル
301	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
302	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
303	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
304	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
305	CF_3	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
306	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
307	シクロプロピル	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
308	1-メチルシクロプロピル	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
309	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
310	1-シアノシクロプロピル	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
311	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
312	CF_2CH_3	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピロリジニル
313	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピペリジニル
314	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピペリジニル
315	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピペリジニル
316	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピペリジニル
317	CF_3	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピペリジニル
318	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピペリジニル
319	シクロプロピル	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピペリジニル
320	1-メチルシクロプロピル	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピペリジニル
321	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピペリジニル
322	1-シアノシクロプロピル	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピペリジニル
323	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピペリジニル
324	CF_2CH_3	CH_3	3,3-ジフルオロ-1-ピペリジニル

10

20

30

40

50

【表 1 - 10】

325	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	4,4-ジフルオロ-1-ピペリジル
326	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	4,4-ジフルオロ-1-ピペリジル
327	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	4,4-ジフルオロ-1-ピペリジル
328	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	4,4-ジフルオロ-1-ピペリジル
329	CF_3	CH_3	4,4-ジフルオロ-1-ピペリジル
330	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	4,4-ジフルオロ-1-ピペリジル
331	シクロプロピル	CH_3	4,4-ジフルオロ-1-ピペリジル
332	1-メチルシクロプロピル	CH_3	4,4-ジフルオロ-1-ピペリジル
333	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	4,4-ジフルオロ-1-ピペリジル
334	1-シアノシクロプロピル	CH_3	4,4-ジフルオロ-1-ピペリジル
335	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	4,4-ジフルオロ-1-ピペリジル
336	CF_2CH_3	CH_3	4,4-ジフルオロ-1-ピペリジル
337	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	4,5-ジヒドロ-3H-ピリダジン-2-イル
338	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	4,5-ジヒドロ-3H-ピリダジン-2-イル
339	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	4,5-ジヒドロ-3H-ピリダジン-2-イル
340	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	4,5-ジヒドロ-3H-ピリダジン-2-イル
341	CF_3	CH_3	4,5-ジヒドロ-3H-ピリダジン-2-イル
342	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	4,5-ジヒドロ-3H-ピリダジン-2-イル
343	シクロプロピル	CH_3	4,5-ジヒドロ-3H-ピリダジン-2-イル
344	1-メチルシクロプロピル	CH_3	4,5-ジヒドロ-3H-ピリダジン-2-イル
345	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	4,5-ジヒドロ-3H-ピリダジン-2-イル
346	1-シアノシクロプロピル	CH_3	4,5-ジヒドロ-3H-ピリダジン-2-イル
347	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	4,5-ジヒドロ-3H-ピリダジン-2-イル
348	CF_2CH_3	CH_3	4,5-ジヒドロ-3H-ピリダジン-2-イル
349	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	オキサジナン-2-イル
350	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_3	オキサジナン-2-イル
351	$\text{C}(\text{F})=\text{CH}_2$	CH_3	オキサジナン-2-イル
352	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$	CH_3	オキサジナン-2-イル
353	CF_3	CH_3	オキサジナン-2-イル
354	$\text{CH}=\text{CH}_2$	CH_3	オキサジナン-2-イル
355	シクロプロピル	CH_3	オキサジナン-2-イル
356	1-メチルシクロプロピル	CH_3	オキサジナン-2-イル
357	1-フルオロシクロプロピル	CH_3	オキサジナン-2-イル
358	1-シアノシクロプロピル	CH_3	オキサジナン-2-イル
359	$\text{CF}(\text{CH}_3)_2$	CH_3	オキサジナン-2-イル
360	CF_2CH_3	CH_3	オキサジナン-2-イル

10

20

30

40

【0089】

表 A 2 は、 R_1 が CH_3 であり、並びに、 R_2 、 R_3 及び R_4 がすべて H であり、並びに、 R_5 、 R_6 及び R_7 の値が上記の表 Z に定義されているとおりである、360種の式 (I - a) の化合物を提供する。

【0090】

表 A 3 は、 R_1 が F であり、並びに、 R_2 、 R_3 及び R_4 がすべて H であり、並びに、 R_5 、 R_6 及び R_7 の値が上記の表 Z に定義されているとおりである、360種の式 (I - a) の化合物を提供する。

【0091】

50

表 A 4 は、 R_1 が C 1 であり、並びに、 R_2 、 R_3 及び R_4 がすべて H であり、並びに、 R_5 、 R_6 及び R_7 の値が上記の表 Z に定義されているとおりである、360 種の式 (I - a) の化合物を提供する。

【0092】

表 A 5 は、 R_1 が F であり、 R_2 が F であり、 R_3 及び R_4 が共に H であり、並びに、 R_5 、 R_6 及び R_7 の値が上記の表 Z に定義されているとおりである、360 種の式 (I - a) の化合物を提供する。

【0093】

表 A 6 は、 R_1 が F であり、 R_2 が H であり、 R_3 が CH_3 であると共に R_4 が H であり、並びに、ここで、 R_5 、 R_6 及び R_7 の値が上記の表 Z に定義されているとおりである、360 種の式 (I - a) の化合物を提供する。

10

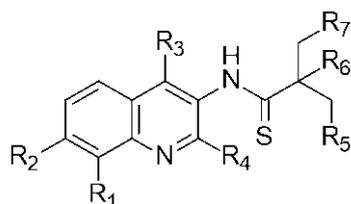
【0094】

表 A 7 は、 R_1 が F であり、 R_2 が H であり、 R_3 が H であると共に R_4 が CH_3 であり、並びに、ここで、 R_5 、 R_6 及び R_7 の値が上記の表 Z に定義されているとおりである、360 種の式 (I - a) の化合物を提供する。

【0095】

表 A 8 は、360 種の式 (I - b) の化合物

【化 5】



20

(I-b)

を提供し、式中、 R_1 は F であり、 R_2 、 R_3 及び R_4 はすべて H であり、並びに、 R_5 、 R_6 及び R_7 の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0096】

本発明の化合物は、以下のスキームにおいて示されているとおり形成可能であり、ここで、別段の定めがある場合を除き、各可変要素の定義は、式 (I) の化合物について上記に定義されているとおりである。

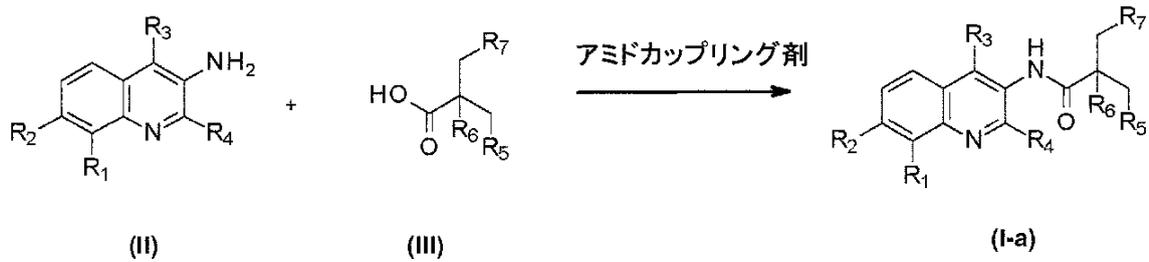
30

【0097】

式 (I - a) の化合物 (式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 及び R_7 は式 (I) の化合物について定義されているとおりである) の調製について種々の報告されている方法のうち、テトラヒドロフラン (THF) 又はジメチルホルムアミド (DMF) のような不活性有機溶剤における、ホスゲン、塩化チオニル若しくは塩化オキサリルのような活性化剤、又は、ジシクロヘキシルカルボジイミドのようなアミドカップリング試薬によるカルボン酸 (III) (式中、 R_5 、 R_6 及び R_7 は式 (I) の化合物について定義されているとおりである) の処理、並びに、ジメチルアミノピリジンのような触媒の存在下における式 (II) のアミン (式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 は、式 (I) の化合物について定義されているとおりである) を伴う反応を含むものをもっとも広範に適用され、これらは、Chem. Soc. Rev., 2009, 606 - 631、又は、Tetrahedron 2005, 10827 - 10852 に記載されている。これはスキーム 1 に示されている。スキーム 1

40

【化6】



10

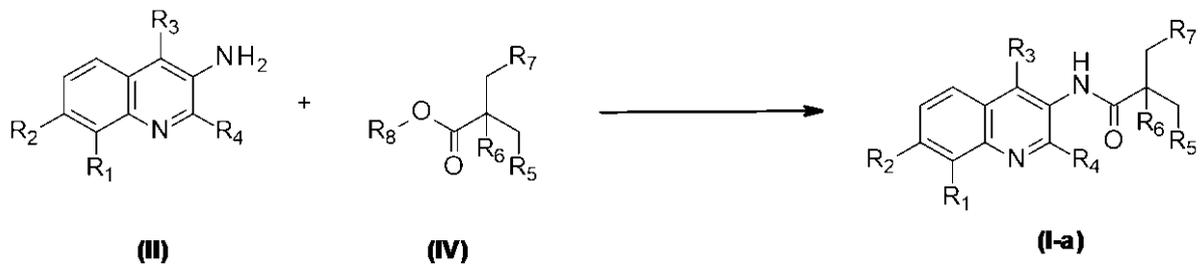
【0098】

式(I-a)の化合物(式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆及びR₇は、式(I)の化合物について定義されているとおりである)は、トルエンのような不活性有機溶剤中における、加熱下での式(II)の化合物(式中、R₁、R₂、R₃及びR₄は式(I)の化合物について定義されているとおりである)と、式(IV)のエステル(式中、R₅、R₆及びR₇は、式(I)の化合物について定義されているとおりであり、並びに、R₈は、C₁~C₆アルキル又はフェニルである)とのトリメチルアルミニウムなどのルイス酸を伴う反応によって調製可能である。これはスキーム2に示されている。

スキーム2

20

【化7】



【0099】

或いは、式(I-a)の化合物(式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆及びR₇は式(I)の化合物について定義されているとおりである)は、炭酸セシウム又はナトリウムt-ブトキシドなどの塩基の存在下、酸化銅、銅(I)アセチルアセトネート若しくは臭化銅(I)-1,10-フェナントロリン錯体などの銅系触媒、ジクロロ(1,3-ビス(ジフェニルホスフィノ)プロパン)ニッケルなどのニッケル触媒、又は、クロロ(2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2',4',6'-トリイソプロピル-1,1'-ビフェニル)[2-(2'-アミノ-1,1'-ビフェニル)]パラジウム(II)、X-Phosアミノビフェニル塩化パラジウムプレ触媒又は[1,3-ビス(2,6-ジイソプロピルフェニル)イミダゾール-2-イリデン](3-クロロピリジル)パラジウム(II)ジクロリドなどのパラジウム系触媒などの遷移金属触媒の存在下、トルエン又はN,N-ジメチルホルムアミドなどの非プロトン性溶剤中、室温又は加熱を伴う、化合物(V)(式中、R₁、R₂、R₃及びR₄は、式(I)の化合物について定義されているとおりであり、並びに、Halは、ハロゲン、好ましくはクロロ、プロモ又はヨードである)と、化合物(VI)(式中、R₅、R₆及びR₇は、式(I)の化合物について定義されているとおりである)とのカップリングにより調製可能である。これはスキーム3に示されている。

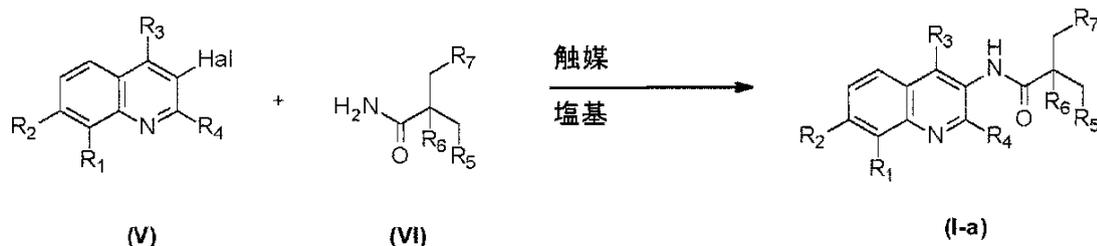
スキーム3

30

40

50

【化 8】



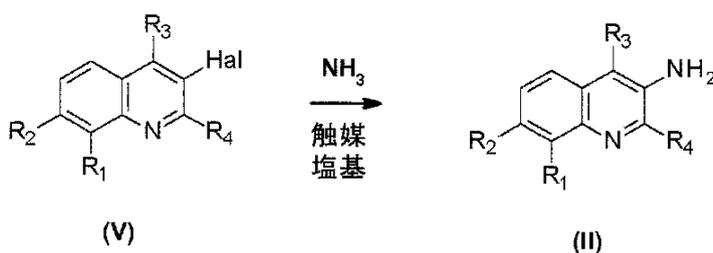
10

【0100】

式 (II) の化合物 (式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 は、式 (I) の化合物について定義されているとおりである) は、リン酸カリウム、炭酸セシウム又はナトリウム *t*-ブトキシド塩基の存在下、銅 (I) アセチルアセトネート、酸化銅又はヨウ化銅 (I) などの銅系触媒の存在下、1, 10-フェナントロリン又は *L*-プロラインなどのリガンドの存在下における、化合物 (V) (式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 は、式 (I) の化合物について定義されているとおりであり、並びに、Hal は、ハロゲン、好ましくはクロロ、ブromo又はヨードである) と、アンモニア、アンモニウム塩 (水酸化アンモニウム又は酢酸アンモニウムのようなもの) とのカップリングによって調製可能である。或いは、この反応は、クロロ (2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2', 4', 6'-トリイソプロピル-1, 1'-20-ビフェニル) [2-(2'-アミノ-1, 1'-ビフェニル)] パラジウム (II)、X-Phos アミノビフェニル塩化パラジウムプレ触媒又は [1, 3-ビス (2, 6-ジイソプロピルフェニル) イミダゾール-2-イリデン] (3-クロロピリジル) パラジウム (II) ジクロリド又はニッケルジシクロオクタジエンなどのパラジウム又はニッケル系遷移金属触媒の存在下に、リガンドとして Josiphos SL-J003-1 を組み合わせて行うことが可能である。この反応は、トルエン、ジオキサン又は *N,N*-ジメチルホルムアミドなどの種々の非プロトン性溶剤中に、室温で又は加熱を伴って行うことが可能である。例えば、同様の化合物の調製が、Organic Letters 2016, 18 (6), 1442-1445 に記載されている。これはスキーム 4 に示されている。

30

【化 9】



40

【0101】

或いは、式 (II) の化合物 (式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 は式 (I) の化合物について定義されているとおりである) は、スキーム 4 に記載されているものなどの遷移金属触媒条件下における、化合物 (V) (式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 は、式 (I) の化合物について定義されているとおりであり、並びに、Hal は、ハロゲン、好ましくはクロロ、ブromo又はヨードである) と、第一級アミン $R_9\text{NH}_2$ (VII) (式中、 R_9 は、ベンジル又はアルキルカルボニルなどの保護基である) とのカップリング、続いて、Green's Protective Groups in Organic Synthesis (Peter G.M. Wuts, Theodora W. Greene, John Wiley & Sons Ed.) に記載されているものなどの種々の条件下における基 R_9

50

の脱保護によって調製可能である。

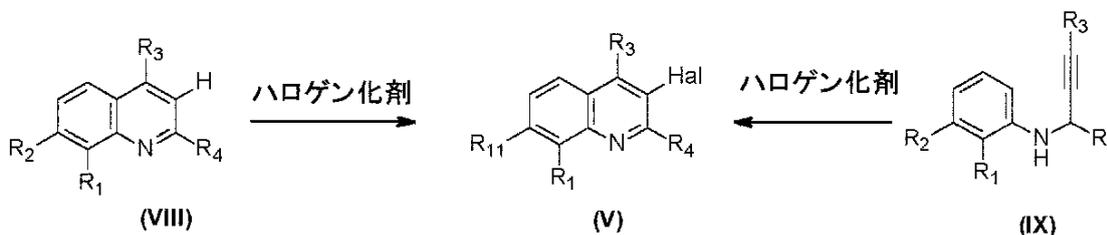
【0102】

式(V)の化合物(式中、R₁、R₂、R₃及びR₄は、式(I)の化合物について定義されているとおりであり、並びに、Halは、ハロゲン、好ましくはクロロ、プロモ又はヨードである)は、国際公開第2005113539号又は特開2001322979号公報に記載されているとおり、アセトニトリル又は酢酸などの不活性溶剤中、室温又は加熱を伴う、N-ヨードスクシンイミド、臭素又は塩素のようなハロゲン化剤による式(VII)の化合物(式中、R₁、R₂、R₃及びR₄は式(I)の化合物について定義されているとおりである)の処理によって調製可能である。或いは、式(V)の化合物(式中、R₁、R₂、R₃及びR₄は、式(I)の化合物について定義されているとおりであり、並びに、Halは、ハロゲン、好ましくはクロロ、プロモ又はヨードである)は、Org. Lett. 2005, 763-766に記載されているとおり、アセトニトリルのような不活性溶剤及び炭酸水素ナトリウムのような塩基中、0 ~ 80 の温度における、ヨウ素又は臭素のようなハロゲン化剤による式(IX)のプロパルギル化アニリン(式中、R₁、R₂、R₃及びR₄は式(I)の化合物について定義されているとおりである)の処理により調製可能である。これはスキーム5に示されている。

10

スキーム5

【化10】



20

【0103】

式(VIII)の化合物及び式(IX)の化合物(式中、R₁、R₂、R₃及びR₄は式(I)の化合物について定義されているとおりである)は、RSC Adv. 2014, 4, 24463、又は、March's Advanced Organic Chemistry, Smith and March, 6th edition, Wiley, 2007に記載されているとおり、当業者に公知である種々の合成技術を用いて調製可能である。

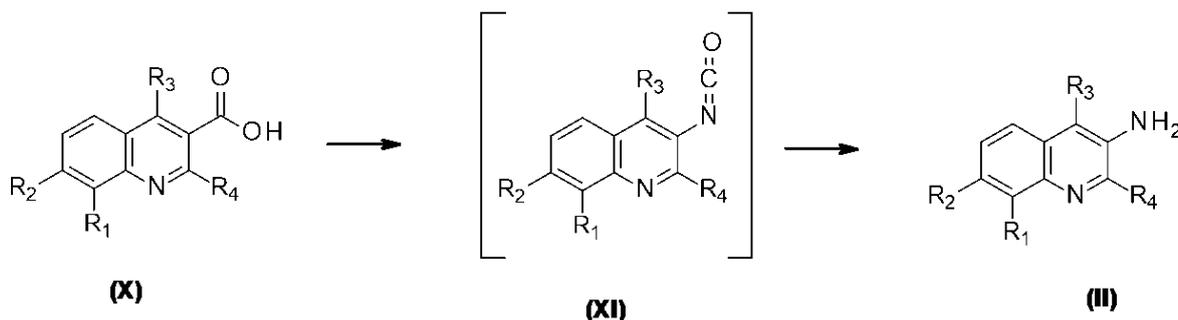
30

【0104】

或いは、式(II)の化合物(式中、R₁、R₂、R₃及びR₄は、式(I)の化合物について定義されているとおりである)はまた、式(X)のカルボン酸から式(XI)の中間体イソシアネートを介して調製可能であり、式(XI)の中間体イソシアネートは、0 ~ 100 の温度で、スキーム6に示されているとおり、水性酸又は塩基を伴って加水分解可能である。

スキーム6

【化11】



40

【0105】

50

イソシアネート (X I) への酸 (X) の変換について報告されている種々のプロトコルのうち、以下のものが、広範な用途を有することが見出された。

【0106】

1) Aust. J. Chem., 1973, 1591-3 に記載されている、イソシアネート (X I) をもたらず、トルエンのような不活性有機溶剤中、50 ~ 120 の温度における、ジフェニルホスホリルアジド及びトリブチルアミンのようなアミン塩基による酸 (X) の処理。

【0107】

2) Synthesis 2011, 1477-1483 に記載されている、アジ化ナトリウムのようなアジド供給源及びトリエチルアミンのようなアミン塩基の存在下、THF のような不活性溶剤中、20 ~ 100 の温度における塩化チオニル又はプロピルホスホン酸無水物のような活性化剤による酸 (X) の処理。

10

【0108】

3) トルエンのような不活性有機溶媒中、20 ~ 120 の温度で、塩化パラ-トルエンスルホニルのような脱水剤及びトリエチルアミンのような塩基で次に処理され得る、対応するヒドロキサム酸への酸 (X) の変換。

【0109】

4) J. Org. Chem. 1984, 4212-4216 に記載されている、アセトニトリルのような溶媒中、0 ~ 100 の温度で、ジアセトキシヨードベンゼンなどの酸化剤及びトリフルオロ酢酸又はパラ-トルエンスルホン酸などの酸で次に処理され得る、対応する第一級カルボキサミドへの酸 (X) の変換。

20

【0110】

5) 水又はメタノールのような溶媒中、0 ~ 100 の温度で、臭素などの酸化剤及び水酸化ナトリウムなどの塩基で次に処理され得る、対応する第一級カルボキサミドへの酸 (X) の変換。

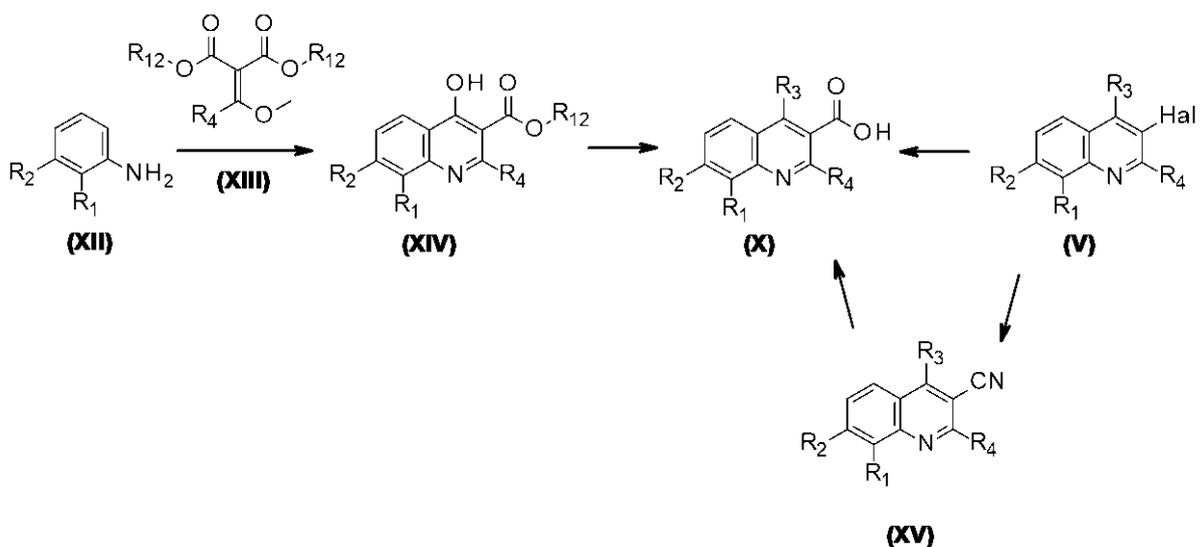
【0111】

式 (X) のカルボン酸 (式中、R₁、R₂、R₃ 及び R₄ は、式 (I) の化合物について定義されているとおりである) は、スキーム 7 に示されているとおり種々の方法により調製可能であり、及び、多くが市販されている。

スキーム 7

30

【化12】



40

【0112】

これらの調製について多くの報告されている方法のうち、以下のものが広範に適用されている。

【0113】

50

1) ジフェニルエーテルのような不活性溶剤中、100 ~ 260 の温度(米国特許出願公開第20070015758号明細書に記載されているとおり)における式(XII)のマロン酸誘導体(式中、R₁₂はC1~C6アルキルであり、及び、R₄は式(I)の化合物について定義されているとおりである)を伴う反応による式(XII)のアニリンから式(XIV)のキノロンへの変換、これに続く、当業者に一般に公知であると共に、国際公開第2007133637号にも記載されている周知の官能基相互変換。

【0114】

2) THFのようなエーテル系溶剤中、-90 ~ +20 の温度における、s-ブチルリチウムのようなアルキルリチウム試薬を伴うリチウム-ハロゲン交換による式(V)の化合物から有機金属中間体への変換、又は、トリ-n-ブチルマグネシウム(magnesium)を伴うマグネシウム-ハロゲン交換、及び、その後の、CO₂を伴う反応。

10

【0115】

3) J. Am. Chem. Soc. 2013, 2891-2894 (及び、参照されている文献)、又は、Tetrahedron 2003, 8629-8640に記載されている、一酸化炭素供給源、トリエチルアミンのような塩基、水又はその均等物、及び、例えばパラジウムを含有する好適に連結された遷移金属触媒の存在下における、式(V)の化合物の変換。

【0116】

4) 塩基性又は酸性水性条件下における式(XV)の化合物の加水分解。スキーム7に示されているとおり、式(XV)の化合物は、J. Org. Chem. 2011, 665-668、又は、Bull. Chem. Soc. Jpn. 1993, 2776-8に記載されているとおり、式(V)の化合物から、パラジウム、ニッケル又は銅触媒の存在下、DMFのような不活性溶剤中、20 ~ 150 の温度における、シアン化亜鉛のようなシアン化物供給源を伴う処理により調製可能である。

20

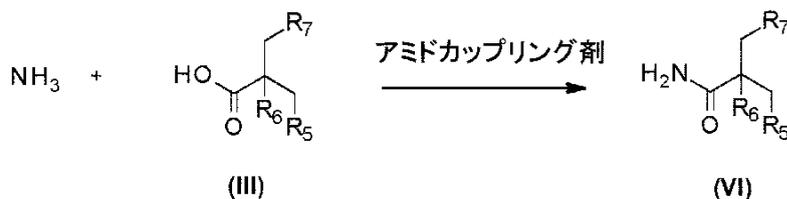
【0117】

式(VI)の化合物(式中、R₅、R₆及びR₇は式(I)の化合物について定義されているとおりである)の調製について種々の報告されている方法のうち、テトラヒドロフラン(THF)のような不活性有機溶剤における、ホスゲン、塩化チオニル若しくは塩化オキサリルのような活性化剤、又は、ジシクロヘキシルカルボジイミドのようなアミドカップリング試薬によるカルボン酸(III)(式中、R₅、R₆及びR₇は式(I)の化合物について定義されているとおりである)の処理、並びに、ジメチルアミノピリジンのような触媒の存在下又は不在下における、アンモニア又は塩化アンモニウム若しくは水酸化アンモニウムなどのアンモニウム塩を伴う反応(Chem. Soc. Rev., 2009, 606-631、又は、Tetrahedron 2005, 10827-10852に記載されているとおり)を含むものがもっとも広範に適用される。これはスキーム8に示されている。

30

スキーム8

【化13】



40

【0118】

当業者は、式(III)のカルボン酸は対応するエステルから調製可能であることを認識するであろう。同様に、当業者は、March's Advanced Organic Chemistry, Smith and March, 6th edition, Wiley

50

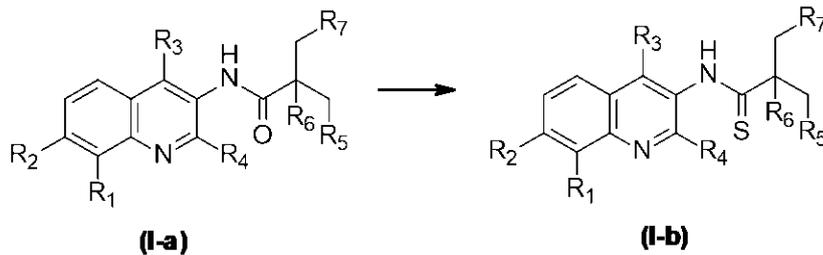
y, 2007に記載されているとおり、これらのエステル有位は、THFのような不活性溶剤中、-78 ~ 20の温度におけるリチウムジイソプロピルアミンのような強塩基による脱プロトン化、これに続く、アルキルヨードなどの求電子性試薬を伴う反応によって官能基化が可能であることを認識するであろう。この反応を反復し、導入したアルキル、アルケニル及びアルキニル基を、ハロゲン化、シクロプロパン化、酸化又は還元、クロスカップリング(例えば菌頭カップリング)によりさらに官能基化して、市販されているエステルから酸誘導体を調製することが可能である。

【0119】

スキーム9に示されているとおり、一般式(I-b)の化合物(式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆及びR₇は式(I)の化合物について定義されているとおりである)は、一般式(I-a)の化合物(式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆及びR₇は式(I)の化合物について定義されているとおりである)から、トルエンのような不活性有機溶剤中、20 ~ 150の温度における、P₄S₁₀又はローソン試薬のようなデオキシチオネート化剤による処理によって調製可能である。

スキーム9

【化14】



【0120】

或いは、式(I-a)の化合物(式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆及びR₇は、式(I)の化合物について定義されているとおりである)は、当業者に公知である標準的な合成技術を用いる他の密接に関連している式(I-a)の化合物の変換によって得ることが可能である。非網羅的な例としては、酸化反応、還元反応、加水分解反応、カップリング反応、芳香族求核若しくは求電子置換反応、求核置換反応、求核付加反応オレフィン化反応、オキシム形成、アルキル化、シクロプロパン化及びハロゲン化反応が挙げられる。

【0121】

上記のスキームに記載の一定の中間体は新規のものであり、従って、本発明のさらなる態様を構成する。

【0122】

式(I)の化合物は、農業部門及び関連する使用分野において、例えば、植物有害生物又は非生体材料の防除、ヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物若しくは生物の防除に係る有効成分として用いられることが可能である。新規化合物は、低施用量での優れた活性、植物による優れた耐容性、及び、環境に対して安全であることにより際だって優れたものである。これらはきわめて有用な治療的特性、予防的特性及び浸透移行特性を有すると共に、数多くの栽培植物の保護に用いられ得る。式(I)の化合物は、有用な植物の異なる作物の植物又は植物の一部(果実、花、葉、茎、塊茎、根)に生じる有害生物を阻害又は駆除するために、他方では、同時に、後に成長する植物のこれらの部位をも例えば植物病原性微生物から保護するために用いられることが可能である。

【0123】

式(I)の化合物を殺菌・殺カビ剤として用いることも可能である。「殺菌・殺カビ剤」という用語は、本明細書において用いられるところ、真菌の増殖を防除し、変性させ、又は、防止する化合物を意味する。「殺菌・殺カビ的に有効な量」という用語は、真菌の増殖に効果をもたらすことが可能である、このような化合物又はこのような化合物の組み合わせの量を意味する。防除又は変性効果は、死滅、遅滞等などの自然の発育からの逸脱

のすべてを含み、予防は、真菌による感染を予防するための植物におけるバリア又は他の防御形成を含む。

【0124】

土壤中で発生する真菌性感染症、並びに、植物病原性真菌に対する保護のために、例えば果実、塊茎若しくは穀粒などの種子又は植物挿穂（例えばイネ）といった植物繁殖体を処理する粉衣剤として式（I）の化合物を用いることも可能である。この繁殖体は、植え付け前に式（I）の化合物を含む組成物で処理することが可能である：例えば、種子は、播種される前に粉衣されることが可能である。式（I）の化合物はまた、種子を液体配合物中に含浸させるか、又は、種子を固体配合物でコーティングすることにより穀粒に適用（コーティング）することが可能である。組成物はまた、繁殖体が植え付けられる際に植え付け箇所に適用が可能であり、例えば、播種の最中において蒔き溝に適用が可能である。本発明はまた、このような植物繁殖体の処理方法、及び、このようにして処理された植物繁殖体にも関する。

10

【0125】

さらに、本発明に係る化合物は、例えば、木材及び木材系工業用製品を含む工業用材料の保護、食品保管、衛生管理といった関連する分野における真菌の防除に用いられることが可能である。

【0126】

加えて、本発明は、例えば材木、壁板及び塗料といった非生体材料を真菌による作用から保護するために用いられることが可能である。

20

【0127】

これらを含む式（I）の化合物及び殺菌・殺カビ組成物を用いて、広範囲の真菌性植物病原体によって引き起こされる植物病害を防除し得る。これらは、観賞用作物、芝生、野菜、農作物、穀類及び果実作物の葉病原体などの広範囲の植物病害の防除において効果的である。

【0128】

防除され得る、これらの病害に係る真菌及び真菌媒介物、並びに、植物病原性バクテリア及びウイルスは、例えば以下のとおりである。

アブシジアコリムピフェラ (*Absidia corymbifera*)、アルテルナリア属の一種 (*Alternaria* spp)、アファノミセス属の一種 (*Aphanomyces* spp)、アスコキタ属の一種 (*Ascochyta* spp)、*A. フラバス* (*A. flavus*)、*A. フミガーツス* (*A. fumigatus*)、*A. ニズラン* (*A. nidulans*)、*A. ニガー* (*A. niger*)、*A. テルス* (*A. terrus*) を含むアスペルギルス属の一種 (*Aspergillus* spp.)、*A. プルランス* (*A. pullulans*) を含むアウレオバシジウム属の一種 (*Aureobasidium* spp.)、*ブラストミセスデルマチチディス* (*Blastomyces dermatitidis*)、*ブルメリアグラミニス* (*Blumeria graminis*)、*ブレミアラクツカエ* (*Bremia lactucae*)、*B. ドチデア* (*B. dothidea*)、*B. オブツサ* (*B. obtusa*) のボトリオスファエリア属の一種 (*Botryosphaeria* spp.)、*B. シネレア* (*B. cinerea*) を含むボトリチス属の一種 (*Botrytis* spp.)、*C. アルピカンス* (*C. albicans*)、*C. グラブラータ* (*C. glabrata*)、*C. クルセイ* (*C. krusei*)、*C. ルシタニエ* (*C. lusitaniae*)、*C. パラプシロシス* (*C. parapsilosis*)、*C. トロピカリス* (*C. tropicalis*) のカンジダ属の一種 (*Candida* spp.)、*セファロアスクスフラグラン* (*Cephaloascus fragrans*)、*セラトシスチス*属の一種 (*Ceratocystis* spp)、*C. アラキジコラ* (*C. arachidicola*) を含むセルコスポラ属の一種 (*Cercospora* spp.)、*セルコスפורジウムペルソナツム* (*Cercosporidium personatum*)、*クラドスポリウム*属の一種 (*Cladosporium* spp)、*クラビセプスプルプレア* (*Claviceps*

30

40

50

purpurea)、

コクシジオイデスイミティス (*Coccidioides immitis*)、コクリオボルス属の一種 (*Cochliobolus* spp)、*C. ムサエ* (*C. musae*) を含むコレトトリカム属の一種 (*Colletotrichum* spp.)、

クリプトコッカスネオフォルマンズ (*Cryptococcus neoformans*)、ジアポルテ属の一種 (*Diaporthe* spp)、ジディメラ属の一種 (*Didymella* spp)、ドレックスレラ属の一種 (*Drechslera* spp)、エルシノエ属の一種 (*Elsinoe* spp)、

エピデルモフィトン属の一種 (*Epidermophyton* spp)、エルウィニアアミロボラ (*Erwinia amylovora*)、*E. シコラセアルム* (*E. cichoracearum*) を含むエリシフェ種 (*Erysiphe* spp.)、

ユーチパラタ (*Eutypa lata*)、*F. クルモルム* (*F. culmorum*)、*F. グラミネアルム* (*F. graminearum*)、*F. ラングセチエ* (*F. langsethiae*)、*F. モニリホルム* (*F. moniliforme*)、*F. オキシスポルム* (*F. oxysporum*)、*F. プロリフェラツム* (*F. proliferatum*)、*F. スブグルチナンス* (*F. subglutinans*)、*F. ソラニ* (*F. solani*) を含むフザリウム属の一種 (*Fusarium* spp.)、

ゲーウマノミセスグラミニス (*Gaeumannomyces graminis*)、ギベレラフジクロイ (*Gibberella fujikuroi*)、グロエオデスポミゲナ (*Gloeodes pomigena*)、

グロエオスポリウムムサルム (*Gloeosporium musarum*)、グロメレラシングレート (*Glomerella cingulate*)、

ガイグナルディアビドウェリイ (*Guignardia bidwellii*)、ギムノスポランギウム ジュニペリ - ヴィルギニアネ (*Gymnosporangium juniperi-virginianae*)、

ヘルミントスポリウム属の一種 (*Helminthosporium* spp)、ヘミレイア属の一種 (*Hemileia* spp)、

H. カプスラツム (*H. capsulatum*) を含むヒストプラズマ属の一種 (*Histoplasma* spp.)、ラエチサリアフシホルミス (*Laetisaria fuciformis*)、

レプトグラフィウムリンデルベルギ (*Leptographium lindbergii*)、レveilラタウリカ (*Leveillula taurica*)、

ロフォデルミウムセディチオスム (*Lophodermium seditiosum*)、コムギ赤かび病菌 (*Microdochium nivale*)、

ミクロスポルム属の一種 (*Microsporum* spp)、モニリニア属の一種 (*Monilinia* spp)、

ムコール属の一種 (*Mucor* spp)、コムギ葉枯病菌 (*M. graminicola*)、*M. ポミ* (*M. pomi*) を含むミコスファエレラ属の一種 (*Mycosphaerella* spp.)、

オンコバシジウムテオブロマエオン (*Oncobasidium theobromaenon*)、オフィオストマピセエ (*Ophiostoma piceae*)、

パラコジディオイデス属の一種 (*Paracoccidioides* spp)、*P. デイジタツム* (*P. digitatum*)、*P. イタリアクム* (*P. italicum*) を含むペニシリウム属の一種 (*Penicillium* spp.)、

ペトリエリジウム属の一種 (*Petriellidium* spp)、*P. メイディス* (*P. maydis*)、*P. フィリピンシス* (*P. philippinensis*) 及び *P. ソルギ* (*P. sorghi*) を含むペロノスクレロスポラ属の一種 (*Peronosclerospora* spp.)、

ペロノスポラ属の一種 (*Peronospora* spp)、コムギふ枯病菌 (*Phaeosphaeria nodorum*)、ファコブソラパチリジ (*Phakopsora pachyrhizi*)、フェリヌスイグニアルス (*Phellinus igniarius*)、

フィアロフォラ属の一種 (*Phialophora* spp)、フオーマ属の一種 (*Phoma* spp)、ホモプシスピティコーラ (*Phomopsis viticola*)、*P. インフェスタンス* (*P. infestans*) を含むフィトフトラ属の一種 (*Phytophthora* spp.)、*P. ハルステジイ* (*P. halstedii*)、*P. ビチコラ* (*P. viticola*) を含

10

20

30

40

50

むプラスモパラ属の一種 (*Plasmopara* spp.)、プレオスポラ属の一種 (*Pleospora* spp.)、リングうどんこ病菌 (*P. leucotricha*) を含むポドスファエラ属の一種 (*Podosphaera* spp.)、ポリミキサグラミニス (*Polymyxa graminis*)、ポリミキサベタエ (*Polymyxa betae*)、シュードセルコスボレラヘルボトリコイド (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、シュードモナス属の一種 (*Pseudomonas* spp.)、*P. cubensis*、*P. humuli* を含むシュードペロノスポラ属の一種 (*Pseudoperonospora* spp.)、シュードペジザトラケイフィラ (*Pseudopeziza tracheiphila*)、*P. hordei*、*P. recondita*、*P. striiformis*、*P. trititina* を含むプッシニア属の一種 (*Puccinia* spp.)、ピレノペジザ属の一種 (*Pyrenopeziza* spp.)、ピレノフォラ属の一種 (*Pyrenophora* spp.)、イネいもち病菌 (*P. oryzae*) を含むピリクラリア属の一種 (*Pyricularia* spp.)、*P. ultimum* を含むピシウム属の一種 (*Pythium* spp.)、ラムラリア属の一種 (*Ramularia* spp.)、リゾクトニア属の一種 (*Rhizoctonia* spp.)、リゾムコールプシルス (*Rhizomucor pusillus*)、リゾプスアリス (*Rhizopus arrhizus*)、リンコスポリウム属の一種 (*Rhynchosporium* spp.)、*S. apiospermum* 及び *S. proliferans* を含むセドスポリウム属の一種 (*Scedosporium* spp.)、スキゾチリウムボミ (*Schizothyrium pomi*)、スクレロチニア属の一種 (*Sclerotinia* spp.)、スクレロチウム属の一種 (*Sclerotium* spp.)、*S. nodorum*、*S. tritici* を含むセプトリア属の一種 (*Septoria* spp.)、スファエロテカマクラリス (*Sphaerotheca macularis*)、スファエロテカフスカ (*Sphaerotheca fusca*) (スファエロテカフリギネア (*Sphaerotheca fuliginea*))、スポロトリクス属の一種 (*Sporothrix* spp.)、スタゴノスポラノドルム (*Stagonospora nodorum*)、ステムフィリウム属の一種 (*Stemphylium* spp.)、ステレウムヒルスツム (*Stereum hirsutum*)、タナテホルスククメリス (*Thanatephorus cucumeris*)、チエラビオプシスバシコラ (*Thielaviopsis basicola*)、チレチア属の一種 (*Tilletia* spp.)、*T. harzianum*、*T. pseudokoningii*、*T. viride* を含むトリコデルマ属の一種 (*Trichoderma* spp.)、トリコフィトン属の一種 (*Trichophyton* spp.)、チフラ属の一種 (*Typhula* spp.)、ウンシヌラネカトル (*Uncinula necator*)、ウロシスチス (*Urocystis* spp.)、ウスチラゴ属の一種 (*Ustilago* spp.)、*V. inaequalis* を含むベンチュリア属の一種 (*Venturia* spp.)、ベルチシリウム属の一種 (*Verticillium* spp.) 及びキサントモナス属の一種 (*Xanthomonas* spp.)。

【0129】

特に、これらを含む式 (I) の化合物及び殺菌・殺カビ組成物を用いて、担子菌綱 (*Basidiomycete*)、子嚢菌綱 (*Ascomycete*)、卵菌綱 (*Oomycete*) 及び/又は不完全菌類、ブラソクラディオマイセート (*Blasocladiomycete*)、ツボカビ綱 (*Chytridiomycete*)、グロムス門 (*Glomeromycete*) 及び/又はケカビ綱 (*Mucoromycete*) における広範囲の真菌性植物病原体によって引き起こされる植物病害を防除し得る。

【0130】

これらの病原体としては以下が挙げられ得る。

卵菌綱 (Oomycete) であって、以下を含む。フィトフトラカプシシ (*Phytophthora capsici*)、フィトフトラインフェスタンス (*Phytophthora infestans*)、フィトフトラソヤエ (*Phytophthora sojae*)、フィトフトラフラガリエ (*Phytophthora fragariae*)、フィトフトラニコチアナエ (*Phytophthora nicotianae*)、フィトフトラシンナモミ (*Phytophthora cinnamomi*)、フィトフトラシトリコラ (*Phytophthora citricola*)、フィトフトラシトロフトラ (*Phytophthora citrophthora*) 及びフィトフトラエリトロセプチカ (*Phytophthora erythroseptica*) によって引き起こされるものなどのフィトフトラ (*Phytophthora*) 病害；ピシウムアフアニデルマツム (*Pythium aphanidermatum*)、ピシウムアレノマネス (*Pythium arrhenomanes*)、ピシウムグラミニコラ (*Pythium graminicola*)、ピシウムイレグラレ (*Pythium irregulare*) 及びピシウムウルチマム (*Pythium ultimum*) によって引き起こされるものなどのピシウム (*Pythium*) 病害；ペロノスポラデストラクトル (*Peronospora destructor*)、ペロノスポラパラシティカ (*Peronospora parasitica*)、プラズモパラビチコーラ (*Plasmopara viticola*)、プラズモパラハルステジイ (*Plasmopara halstedii*)、シュードペロノスポラクベンシス (*Pseudoperonospora cubensis*)、アルブゴカンジダ (*Albugo candida*)、スクレログトラマクロスポラ (*Sclerophthora macrospora*) 及びブレミアラクツカエ (*Bremia lactucae*) などのツユカビ目 (*Peronosporales*) によって引き起こされる病害；並びに、アフアノミセスコクリオイデス (*Aphanomyces cochlioides*)、ラビリンツラゾステラエ (*Labyrinthula zosterae*)、ペロノスクレロスポラソルギ (*Peronosclerospora sorghi*) 及びスクレロスポラグラミニコラ (*Sclerospora graminicola*) などの他のもの。

【0131】

子囊菌綱 (Ascomycetes) であって、例えば、ステムフィリウムソラニ (*Stemphylium solani*)、スタゴノスポラタイナネンシス (*Stagonospora tainanensis*)、スピロカエアオレアギネア (*Spilocaea oleaginea*)、セトスファエリアアツルシカ (*Setosphaeria turcica*)、ピレノカエタリコペリシチ (*Pyrenochaeta lycopersici*)、プレオスポラヘルバルム (*Pleospora herbarum*)、フォマデストラクティバ (*Phoma destructiva*)、ファエオスファエリアヘルポトリコイデス (*Phaeosphaeria herpotrichoides*)、ファエオクリプトクスガエウマンニイ (*Phaeocryptococcus gaeumannii*)、オフィオスファエレラグラミニコラ (*Ophiosphaerella graminicola*)、オフィボルスグラミニス (*Ophiobolus graminis*)、レプトスファエリアマクランズ (*Leptosphaeria maculans*)、ヘンデルソニアクレベリマ (*Hendersonia creberrima*)、ヘルミントスポリウムトリティシレペンティス (*Helminthosporium tritici repentis*)、セトスファエリアアツルシカ (*Setosphaeria turcica*)、ドレックスレラグリシネス (*Drechslera glycines*)、ジディメラブリオニエ (*Didymella bryoniae*)、シクロコニウムオレアギネウム (*Cycloconium oleagineum*)、コリネスポラカッシイコラ (*Corynespora cassiicola*)、コクリオボルスサチブス (*Cochliobolus sativus*)、ビボラリスカクティボラ (*Bi*

polaris cactivora)、リンゴ黒星病菌 (*Venturia inaequalis*)、ピレノホラテレス (*Pyrenophora teres*)、コムギ黄斑病菌 (*Pyrenophora tritici-repentis*)、アルテルナリアアルテナタ (*Alternaria alternata*)、アルテルナリアブラッシシコラ (*Alternaria brassicicola*)、アルテルナリアソラニ (*Alternaria solani*) 及びアルテルナリアトマトフィラ (*Alternaria tomatophila*) などのプレオスポラ目 (*Pleosporales*) ; セプトリアトリティシ (*Septoria tritici*)、セプトリアノドルム (*Septoria nodorum*)、セプトリアグリシネス (*Septoria glycines*)、セルコスポラアラキディコーラ (*Cercospora arachidicola*)、セルコスポラソジナ (*Cercospora soja*)、セルコスポラセアエマイデイス (*Cercospora zeae-maydis*)、セルコスポレラカプセラエ (*Cercospora capsellae*) 及びセルコスポレラヘルポトリコイデス (*Cercospora herpotrichoides*) などのカブノディウム目 (*Capnodiales*) ; クラドスポリウムカルポフィルム (*Cladosporium carpophilum*)、クラドスポリウムエフスム (*Cladosporium effusum*)、パッサロラフルバ (*Passalora fulva*)、クラドスポリウムオキシスポルム (*Cladosporium oxysporum*)、ドチストロマッセプトスポルム (*Dothiostroma septosporum*)、イサリオブシスクラビスポラ (*Isariopsis clavispora*)、マイコスファエレラフィジエンシス (*Mycosphaerella fijiensis*)、コムギ葉枯病菌 (*Mycosphaerella graminicola*)、マイコベロシエラコエブケイイ (*Mycovellosiella koepkei*)、ファエオイサリオブシスバタチコラ (*Phaeoisariopsis bataticola*)、シュードセルコスポラピチス (*Pseudocercospora vitis*)、シュードセルコスポレラヘルポトリコイド (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、ラムラリアベチコラ (*Ramularia beticola*)、ラムラリアコロシグニ (*Ramularia collocygni*)、ゲーウマノミセスグラミニス (*Gaeumannomyces graminis*)、マグナポルテグリセア (*Magnaporthe grisea*)、イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) などのマグナポルテ目 (*Magnaporthales*) ; アニソグラマアノマラ (*Anisogramma anomala*)、アピオグノモニアエラブンダ (*Apiognomonium errabunda*)、サイトスポラプラタニ (*Cytospora platani*)、ジアポルテファセオロルム (*Diaporthe phaseolorum*)、ディスクラデストルクティバ (*Discula destructiva*)、グノモニアフルクティコーラ (*Gnomonia fructicola*)、グリーネリアウビコーラ (*Greeneria uvicola*)、メランコニウムジュグランドinum (*Melanconium juglandinum*)、ホモブシスピティコーラ (*Phomopsis viticola*)、シロコッカスクラビギグネンティ - ジュグランドinum (*Sirococcus clavignenti-juglandacearum*)、ツバキアドリイナ (*Tubakia dryina*)、ディカルペラ属の一種 (*Dicarpella* spp.)、バルサセラトスペルマ (*Valsa ceratosperma*) などのジアポルテ目 (*Diaporthales*) ; 並びに、アクチノチリウムグラミニス (*Actinothyrium graminis*)、アスコキタピシ (*Ascochyta pisi*)、アスペルギルスフラブス (*Aspergillus flavus*)、アスペルギルスフミガーツス (*Aspergillus fumigatus*)、アスペルギルスニズランス (*Aspergillus nidulans*)、アスペリスポリウムカリカエ (*Asperisporium caricae*)、ブルメリエラジャアピイ (*Blumeriella jaapii*)、カンジダ属の一種 (*Candida* spp.)、カブノジウム

10

20

30

40

50

ラモスム (*Capnodium ramosum*)、セファロアスクス属の一種 (*Cephaloascus spp.*)、セファロスポリウムグラミネウム (*Cephalosporium gramineum*)、セラトシステイスパロドクサ (*Ceratocystis paradoxa*)、キトミウム属の一種 (*Chaetomium spp.*)、ヒメノシフスシュードアルビツス (*Hymenoscyphus pseudoalbidus*)、コッシディオイデス属の一種 (*Coccidioides spp.*)、シリンドロスポリウムパディ (*Cylindrosporium padi*)、ジプロカルボンマラエ (*Diplocarpon malae*)、ドレパノペジザカンペストリス (*Drepanopeziza campestris*)、エルシノエアンペリナ (*Elsinoe ampelina*)、エピコッカムニグラム (*Epicoccum nigrum*)、エピデルモフィトン属の一種 (*Epidermophyton spp.*)、ユーチパラタ (*Eutypa lata*)、ゲオトリクムカンジズム (*Geotrichum candidum*)、ギベリナセラリス (*Gibellina cerealis*)、グロエオセルコスボラソルギ (*Gloeocercospora sorghi*)、グロエオデスポミゲナ (*Gloeodes pomigena*)、グロエオスポリウムペレナンス (*Gloeosporium perennans*) などの他のものによって引き起こされるものといった汚斑病、斑点病、イモチ病又は胴枯れ病及びノ又は腐敗病；グロエオチニアテムレンタ (*Gloeotinia temulenta*)、グリフォスパエリアコルチコラ (*Griphospora corticola*)、カバチエラリニ (*Kabatella lini*)、レプトグラフィウムミクロスポルム (*Leptographium microsporium*)、レプトスファエルリニアクラッサスカ (*Leptosphaerulina crassiasca*)、ロフォデルミウムセディチオスム (*Lophodermium seditiosum*)、マルソニナグラミニコラ (*Marssonina graminicola*)、コムギ赤かび病菌 (*Microdochium nivale*)、モニリニアフルクティコーラ (*Monilinia fructicola*)、モノグラフエラアルベセンス (*Monographella albescens*)、モノスポラスクスカノンバルス (*Monosporascus cannonballus*)、ナエマシクルス属の一種 (*Naemacyclus spp.*)、オフィオストマノボウルミ (*Ophiostomanovo-ulmi*)、パラコシジオイデスブラジリエンシス (*Paracoccidioides brasiliensis*)、ペニシリウムエクソパンスム (*Penicillium expansum*)、ペスタロチアロドデンドリ (*Pestalotia rhododendri*)、ペトリエリジウム属の一種 (*Petriellidium spp.*)、ペジクラ属の一種 (*Pezicula spp.*)、フィアロホラグレガタ (*Phialophora regata*)、フィラコラポミゲナ (*Phyllachora pomigena*)、フィマトトリクムオムニボラ (*Phymatotrichum omnivora*)、フィサロスポラアブディタ (*Physalospora abdita*)、プレクトスポリウムタバシヌム (*Plectosporium tabacinum*)、ポリシタルムプスツランス (*Polyscytalum pustulans*)、シュードペジザメディカギニス (*Pseudopeziza medicaginis*)、ピレノペジザブラッシカエ (*Pyrenopeziza brassicae*)、ラムリスボラソルギ (*Ramulispora sorghi*)、ラブドクリンシュードツガエ (*Rhabdocline pseudotsugae*)、リンコスポリウムセカリス (*Rhynchosporium secalis*)、イネ葉しょう腐敗病菌 (*Sacrocladium oryzae*)、スケドスポリウム属の一種 (*Scedosporium spp.*)、スキゾチリウムボミ (*Schizothyrium pomi*)、スクレロチニアスクレロティオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*)、スクレロチニアミノル (*Sclerotinia minor*)；スクレロチウム属の一種 (*Sclerotium spp.*)、チフライシカリエンシス (*Typhula ishikariensis*)、セイマトスポリウムマリエ (*Seima*

tosporium mariae)、レプテウチパクブレッシ (*Lepteutypa cupressi*)、セプトシタルボルム (*Septocyta ruborum*)、スファセロマベルセー (*Sphaceloma perseae*)、スポロネマファシディオイデス (*Sporonema phacidioides*)、スティグミナパルミボラ (*Stigmina palmivora*)、タペシアヤルンデ (*Tapesia yallundae*)、タフリナブラタ (*Taphrina bullata*)、チエビオブシスバシコラ (*Thielviopsis basicola*)、トリコセプトリアグルクチゲナ (*Trichoseptoria fructigena*)、ジゴフィアラジャミセンシス (*Zygophiala jamaicensis*) ; 例えばブルメリアグラミニス (*Blumeria graminis*)、エリシフェポリゴニ (*Erysiphe polygoni*)、ウンシヌラネカトル (*Uncinula necator*)、スファエロテカフリゲナ (*Sphaerotheca fuliginea*)、リンゴうどんこ病菌 (*Podosphaera leucotricha*)、ポドスパエラマクラリス (*Podosphaera macularis*)、ゴロビノマイセスシコラセルム (*Golovinomyces cichoracearum*)、レベイルラタウリカ (*Leveillula taurica*)、ミクロスファエラディフッサ (*Microsphaera diffusa*)、オイディオブシスゴッシピイ (*Oidiopsis gossypii*)、フィラクチニアグッタタ (*Phyllactinia guttata*) 及びオイジウムアラキディス (*Oidium arachidis*) などのウドンコカビ目 (*Erysiphales*) によって引き起こされるものといったウドンコ病病害 ; 例えばドチオレアラロマチカ (*Dothiorella aromatica*)、ジプロディアセリアタ (*Diplodia seriata*)、ガイグナルディアビドウェリイ (*Guignardia bidwellii*)、ボトリチスシネレア (*Botrytis cinerea*)、ボトリオチニアアリイ (*Botryotinia allii*)、ボトリオチニアファビ (*Botryotinia fabae*)、フシコクムアミグダリ (*Fusicoccum amygdali*)、ラシオジプロディアテオブロマエ (*Lasio-diplodia theobromae*)、マクロフォーマテイコラ (*Macrophoma theicola*)、マクロフォミナファセオリナ (*Macrophomina phaseolina*)、フィロスティクタククルビタセアルム (*Phyllosticta cucurbitacearum*) などのボトリオスフェリア目 (*Botryosphaeriales*) によって引き起こされるものといったかび類 ; 例えばコレトトリカムグロエオスポリオイデス (*Colletotrichum gloeosporioides*)、コレトトリカムラゲナリウム (*Colletotrichum lagenarium*)、コレトトリカムゴッシピイ (*Colletotrichum gossypii*)、グロメララシングラタ (*Glomerella cingulata*) 及びコレトトリカムグラミニコラ (*Colletotrichum graminicola*) などのグロメララレス属 (*Glomerellales*) によって引き起こされるものといった炭疽病 ; 並びに、例えばアクレモニウムストリクツム (*Acremonium strictum*)、クラビセプスプルプレア (*Claviceps purpurea*)、フザリウムクルモルム (*Fusarium culmorum*)、フザリウムグラミネアルム (*Fusarium graminearum*)、フザリウムビルグリホルム (*Fusarium virguliforme*)、フザリウムオキシスポルム (*Fusarium oxysporum*)、フザリウムスブグルチナンス (*Fusarium subglutinans*)、フザリウムオキシスポルム (*Fusarium oxysporum* f. sp. *cubense*)、ゲルラキアニバレ (*Gerlachia nivalis*)、ギベレラフジクロイ (*Gibberella fujikuroi*)、ギベレラゼアエ (*Gibberella zeae*)、グリオクラジウム属の一種 (*Gliocladium* spp.)、ミロテシウムベルカリア (*Myrothecium verrucaria*)、ネクトリアラムラライエ (*Nectria ramulariae*)、トリコデルマビリデ (*Trichoderma viride*)、トリコテシウムロセウム (

Trichothecium roseum) 及びベルチシリウムテオブロマエ (*Verticillium theobromae*) などの肉座菌目 (*Hypocreales*) によって引き起こされるものといった萎凋病又は胴枯れ病。

【0132】

例えばウスチラギノイデアビレンス (*Ustilaginoida virens*)、ウスチラゴヌダ (*Ustilago nuda*)、ウスチラゴトリティシ (*Ustilago tritici*)、ウスチラゴゼアエ (*Ustilago zeae*) などのクロボキン目 (*Ustilaginales*) によって引き起こされるものといった黒穂病菌を含む担子菌綱 (*Basidiomycete*)、例えばセロテリウムフィチ (*Cerotelium fici*)、クリソミクサルクトスタフィリ (*Chrysomyxa arctostaphyli*)、コレオスポリウムイポモエアエ (*Coleosporium ipomoeae*)、ヘミレイアバスタトリクス (*Hemileia vastatrix*)、プッシニアアラキディス (*Puccinia arachidis*)、プッシニアカカバタ (*Puccinia cacabata*)、プッシニアグラミニス (*Puccinia graminis*)、プッシニアレコンディタ (*Puccinia recondita*)、プッシニアソルギ (*Puccinia sorghi*)、プッシニアホルデイ (*Puccinia hordei*)、プッシニアストリイフォルミス (*Puccinia striiformis f. sp. Hordei*)、プッシニアストリイフォルミス (*Puccinia striiformis f. sp. Secalis*)、プッシニアストルムコリリ (*Pucciniastrum coryli*) などのサビキン目 (*Pucciniales*)、又は、クロナルチウムリビコラ (*Cronartium ribicola*)、ジムノスポランギウムジュニペリ - ビジニアネ (*Gymnosporangium juniperi-viginianae*)、メランプソラメデュサエ (*Melampsora medusae*)、ファコプソラパチリジ (*Phakopsora pachyrhizi*)、フラグミジウムムクロナツム (*Phragmidium mucronatum*)、フィソペラアンペロシディス (*Physopella ampeloidis*)、トランスケリアディスコロール (*Tranzschelia discolor*) 及びウロマイセスビシエ - ファビエ (*Uromyces viciae-fabae*) などのサビキン目 (*Uredinales*) によって引き起こされるものといったサビ病菌；並びに、クリプトコックス属の一種 (*Cryptococcus spp.*)、エクソバシジウムベクスアン (*Exobasidium vexans*)、マラスミエルスイノデルマ (*Marasmiellus inoderma*)、マイセナ属の一種 (*Mycena spp.*)、スファセロテカレイリアナ (*Sphacelotheca reiliana*)、チフライシカリエンシス (*Typhula ishikariensis*)、ウロシスチスアグロピリ (*Urocystis agropyri*)、イテルソニリアペルプレキサンス (*Itersonilia perplexans*)、クルチシウムインビスム (*Corticium invisum*)、ラエチサリアフシホルミス (*Laetisaria fuciformis*)、ワイテアシルシナタ (*Waitea circinata*)、イネ紋枯病菌 (*Rhizoctonia solani*)、テンサイ根腐病菌 (*Thanetophorus cucurmeris*)、エンチロマダリアエ (*Entyloma dahliae*)、エンチロメラミクロスボラ (*Entylomella microspora*)、ネオボシアモリニアエ (*Neovossia molinia*) 及びチレチアカリエス (*Tilletia caries*) によって引き起こされるものなどの他の腐敗病及び病害。

【0133】

フィソデルママイディス (*Physoderma maydis*) などのコウマクノウキン目 (*Blastocladiomycetes*)。

【0134】

コアネフォラククリピタルム (*Choanephora cucurbitarum*)；ムコール属の一種 (*Mucor spp.*)；リゾプスアルヒズス (*Rhizopus*

10

20

30

40

50

arrhizus)などのケカビ綱(Mucoromycetes)。

並びに、上記に列挙されているものと近縁の他の種及び属によって引き起こされる病害。

【0135】

その殺菌・殺カビ活性に追加して、化合物及びこれらを含む組成物はまた、エルウィニアアミロボラ(Erwinia amylovora)、エルウィニアカラトボラ(Erwinia caratovora)、キサントモナスカムペストリス(Xanthomonas campestris)、シュードモナスシリंगाエ(Pseudomonas syringae)、ストルプトマイセススカビイス(Striptomyces scabies)などのバクテリア及び他の関連する種、並びに、一定の原生動物に対する活性を有し得る。

10

【0136】

本発明の範囲内においては、保護されるべき標的作物及び/又は有用な植物は、典型的には、例えばブラックベリー、ブルーベリー、クランベリー、ラズベリー及びイチゴといった液果植物；例えばオオムギ、トウモロコシ(コーン)、キビ、カラスムギ、イネ、ライ麦、モロコシ属(sorghum)ライコムギ及びコムギといった穀類；例えば綿、亜麻、アサ、ジュート及びサイザルといった繊維植物；例えば糖質及び飼料ビート、コーヒー、ホップ、マスタード、アブラナ(カノーラ)、ケシ、サトウキビ、ヒマワリ、チャ及びタバコといった農作物；例えばリンゴ、アンズ、アボカド、バナナ、サクランボ、柑橘類、ネクタリン、モモ、セイヨウナシ及びセイヨウスモモといった果樹；例えばパミューダグラス、イチゴツナギ、ベントグラス、センチピードグラス、ウシノケグサ、ライグラス、アメリカシバ及びノシバといった草；バジル、ルリジサ、チャイブ、コリアンダー、ラベンダー、ラベージ、ミント、オレガノ、パセリ、ローズマリー、セージ及びタイムなどのハーブ；例えばインゲンマメ、レンズマメ、エンドウマメ及びダイズ、インゲンマメといったマメ科植物；例えばアーモンド、カシュー、落花生、ヘーゼルナッツ、ピーナッツ、ペカン、ピスタチオ及びクルミといった堅果；例えばアブラヤシといったヤシ；例えば花、低木及び高木といった観賞用植物；例えばカカオ、ココナツ、オリーブ及びゴムといった他の高木；例えばアスパラガス、ナス、ブロッコリ、キャベツ、ニンジン、キュウリ、ニンニク、レタス、ペポカボチャ、メロン、オクラ、タマネギ、コショウ、ジャガイモ、カボチャ、ダイオウ、ハウレンソウ及びトマトといった野菜；並びに、例えばブドウといったつる植物などの多年生及び1年生作物を含む。

20

30

【0137】

本発明に係る有用な植物及び/又は標的作物は、例えば、昆虫抵抗性(例えばBt、及びVIP品種)並びに病害抵抗性、除草剤耐性(商品名Roundup Ready(登録商標)及びLiberty Link(登録商標)で市販されている例えばグリホサート-及びグルホシネート-耐性トウモロコシ品種)及び線虫抵抗性品種などの従来品種、並びに、遺伝子的に強化又は遺伝子操作された品種を含む。一例として、好適に遺伝子的に強化又は遺伝子操作された品種は、Stoneville 5599 BR綿及びStoneville 4892 BR綿品種を含む。

【0138】

「有用な植物」及び/又は「標的作物」という用語は、従来交配又は遺伝子操作方法によって、プロモキシニルのような除草剤、又は、ある分類の除草剤(例えば、HPPD抑制剤、ALS抑制剤、例えばプリミスルフロン、プロスルフロン及びトリフロキシスルフロン、EPSPS(5-エノール-ピロピル-シキメート-3-リン酸塩-シスターゼ)抑制剤、GS(グルタミンシンターゼ)抑制剤又はPPO(プロトポルフィリノーゲン-オキシダーゼ)抑制剤など)に対する耐性がもたらされた有用な植物をも含むと理解されるべきである。従来交配方法(突然変異誘発)によって、例えばイマザモックスといったイミダゾリノンに対する耐性がもたらされた作物の一例は、Clearfield(登録商標)夏ナタネ(カノーラ)である。遺伝子操作方法によって除草剤又はあるクラス除草剤に対する耐性がもたらされた作物の例としては、商品名Roundup Ready(登録商標)、Herculex I(登録商標)及びLiberty Link(登

40

50

録商標)で市販されているグリホサート - 及びグルホシネート - 耐性トウモロコシ品種が挙げられる。

【0139】

「有用な植物」及び/又は「標的作物」という用語は、自然発生的なもの、又は、有害な昆虫に対する抵抗性が与えられたものを含むと理解されるべきである。これは、トキシン - 産生バクテリア由来として公知であるものなどの1種以上の選択的に作用するトキシンの合成能を例えば有するよう、組換えDNA技術を用いることで形質転換された植物を含む。発現されることが可能であるトキシンの例としては、 δ -エンドトキシン、栄養型殺虫性タンパク質(Vip)、線虫共生バクテリアの殺虫性タンパク質、並びに、サソリ、蛛形類、大型のハチ(wasp)及び真菌によって産生されるトキシンが挙げられる。バチルスチューリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)トキシンを発現するよう変性された作物の一例は、BtトウモロコシKnockOut(登録商標)(Syngenta Seeds)である。殺虫性耐性をコードする2種以上の遺伝子を含み、それ故、2種以上のトキシンを発現する作物の一例は、VipCot(登録商標)(Syngenta Seeds)である。作物又はその種子材料もまた、複数種の有害生物に対して耐性であることが可能である(いわゆる、遺伝子修飾により形成される場合の重畳的なトランスジェニックイベント)。例えば、植物は、例えばHerculex I(登録商標)(Dow AgroSciences, Pioneer Hi-Bred International)のように除草剤耐性であると同時に、殺虫性タンパク質の発現能を有していることが可能である。

【0140】

用語「有用な植物」及び/又は「標的作物」は、例えば、いわゆる「感染特異的タンパク質」(PRP、例えば欧州特許出願公開第0 392 225号明細書を参照のこと)などの選択的な作用を有する抗病原性物質を合成することが可能であるよう組換えDNA技術を用いて形質転換された有用な植物をも含むと理解されるべきである。このような抗病原性物質及びこのような抗病原性物質を合成可能である形質転換植物の例は、例えば、欧州特許出願公開第0 392 225号明細書、国際公開第95/33818号パンフレット及び欧州特許出願公開第0 353 191号明細書から公知である。このような形質転換植物を製造する方法は一般に当業者に公知であると共に、例えば、上記の公報に記載されている。

【0141】

形質転換植物によって発現されることが可能であるトキシンとしては、例えば、セレウス菌(*Bacillus cereus*)又はバチルススピリエ(*Bacillus popilliae*)由来の殺虫性タンパク質;又は、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1若しくはCry9Cといった δ -エンドトキシンなどのバチルスチューリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)由来の殺虫性タンパク質、又は、例えばVip1、Vip2、Vip3若しくはVip3Aといった栄養型殺虫性タンパク質(Vip);又は、フォトラバダスルミネセンス(*Photobacterium luminescens*)、ゼノラバダスネマトフィルス(*Xenorhabdus nematophilus*)などの、例えばフォトラバダス属の一種(*Photobacterium* spp.)若しくはゼノラバダス属の一種(*Xenorhabdus* spp.)といった線虫共生バクテリアの殺虫性タンパク質;サソリトキシン、クモトキシン、大型のハチ(wasp)トキシン及び他の昆虫特異的神経トキシンなどの動物によって生成されるトキシン;ストレプトミセス(*Streptomyces*)トキシンなどの真菌によって生成されるトキシン、エンドウマメレクチン、オオムギレクチン又はマツユキソウレクチンなどの植物レクチン;アグルチニン;トリプシン抑制剤、セリタンパク分解酵素抑制剤、パタチン、シスタチン、パパイン抑制剤などのプロテイナーゼ抑制剤;リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフイン、サボリン又はブリオジンなどのリボソーム - 不活性化タンパク質(RIP);3-ヒドロキシステロイドキシダーゼ、エクジステロイド-UDP-グリ

10

20

30

40

50

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、エクジソン抑制剤、HMG - COA - レダクターゼなどのステロイド代謝酵素、ナトリウム又はカルシウム遮断剤などのイオンチャネル遮断剤、幼虫ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシクターゼ、ピベンジルシクターゼ、キチナーゼ及びグルカナーゼが挙げられる。

【0142】

さらに、本発明の文脈においては、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1若しくはCry9Cといった - エンドトキシン、又は、例えばVip1、Vip2、Vip3若しくはVip3Aといった栄養型殺虫性タンパク質 (Vip) とは、特にハイブリッドトキシン、切断型トキシン及び修飾トキシンでもあることが理解されるべきである。ハイブリッドトキシンは、これらのタンパク質の異なるドメインの新たな組み合わせによって組換えで生成される (例えば、国際公開第02/15701号パンフレットを参照のこと)。例えば切断型Cry1Abといった切断型トキシンが公知である。修飾トキシンの場合、天然トキシンの1種以上のアミノ酸が置換される。このようなアミノ酸置換において、好ましくは自然に存在しないタンパク分解酵素認識配列がトキシンに挿入され、例えば、Cry3A055の場合には、カテプシン - G - 認識配列がCry3Aトキシンに挿入される (国際公開第03/018810号パンフレットを参照のこと)。

10

【0143】

このようなトキシン、又は、このようなトキシンを合成可能な形質転換植物のさらなる例が、例えば、欧州特許出願公開第A - 0374753号明細書、国際公開第93/07278号パンフレット、国際公開第95/34656号パンフレット、欧州特許出願公開第A - 0427529号明細書、欧州特許出願公開第A - 451878号明細書及び国際公開第03/052073号パンフレットに開示されている。

20

【0144】

このような形質転換植物の調製プロセスは一般に当業者に公知であり、例えば、上記の刊行物において記載されている。CryI - タイプデオキシリボ核酸及びその調製は、例えば、国際公開第95/34656号パンフレット、欧州特許出願公開第A - 0367474号明細書、欧州特許出願公開第A - 0401979号明細書及び国際公開第90/13651号パンフレットから公知である。

【0145】

形質転換植物に含有されるトキシンは、有害な昆虫に対する耐性を植物に付与する。このような昆虫は昆虫の分類群のいずれかのものであることが可能であるが、特に、甲虫 (鞘翅目)、双翅昆虫 (双翅目) 及び蝶 (鱗翅目) に通例見出される。

30

【0146】

殺虫耐性をコードし、1種以上のトキシンを発現する1種以上の遺伝子を含む形質転換植物は公知であり、そのいくつかは市販されている。このような植物の例は: YieldGard (登録商標) (Cry1Abトキシンを発現するトウモロコシ品種); YieldGard Rootworm (登録商標) (Cry3Bb1トキシンを発現するトウモロコシ品種); YieldGard Plus (登録商標) (Cry1Ab及びCry3Bb1トキシンを発現するトウモロコシ品種); Starlink (登録商標) (Cry9Cトキシンを発現するトウモロコシ品種); Herculex I (登録商標) (Cry1Fa2トキシン及び酵素ホスフィトリシンN - アセチルトランスフェラーゼ (PAT) を発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成されているトウモロコシ品種); NuCOTN 33B (登録商標) (Cry1Acトキシンを発現する綿品種); Bollgard I (登録商標) (Cry1Acトキシンを発現する綿品種); Bollgard II (登録商標) (Cry1Ac及びCry2Abトキシンを発現する綿品種); VipCot (登録商標) (Vip3A及びCry1Abトキシンを発現する綿品種); NewLeaf (登録商標) (Cry3Aトキシンを発現するジャガイモ品種); NatureGard (登録商標)、Agrisure (登録商標) GT Advantage (GA21グリホサート - 耐性形質)、Agrisure (登録商標)

40

50

) C B Advantage (B t 1 1 コーン穿孔性害虫 (C B) 形質) 及び P r o t e c t a (登録商標) である。

【 0 1 4 7 】

このような形質転換作物のさらなる例は以下のとおりである。

1 . S y n g e n t a S e e d s S A S , C h e m i n d e l ' H o b i t 2 7 , F - 3 1 7 9 0 S t . S a u v e u r , F r a n c e 製 B t 1 1 トウモロコシ、登録番号 C / F R / 9 6 / 0 5 / 1 0 。切断型 C r y 1 A b トキシンのトランスジェニック発現により、アワノメイガ (ヨーロッパアワノメイガ (O s t r i n i a n u b i l a l i s) 及びセサミアノナグリオイデス (S e s a m i a n o n a g r i o i d e s)) に対する耐性が付与された遺伝子操作されたトウモロコシ (Z e a m a y s) 。 B t 1 1 トウモロコシはまた、酵素 P A T をトランスジェニック発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成している。

10

【 0 1 4 8 】

2 . S y n g e n t a S e e d s S A S , C h e m i n d e l ' H o b i t 2 7 , F - 3 1 7 9 0 S t . S a u v e u r , F r a n c e 製 B t 1 7 6 トウモロコシ、登録番号 C / F R / 9 6 / 0 5 / 1 0 。 C r y 1 A b トキシンのトランスジェニック発現によって、アワノメイガ (ヨーロッパアワノメイガ (O s t r i n i a n u b i l a l i s) 及びセサミアノナグリオイデス (S e s a m i a n o n a g r i o i d e s)) に対する耐性が付与された遺伝子操作されたトウモロコシ (Z e a m a y s) 。 B t 1 7 6 トウモロコシはまた、酵素 P A T をトランスジェニック発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成している。

20

【 0 1 4 9 】

3 . S y n g e n t a S e e d s S A S , C h e m i n d e l ' H o b i t 2 7 , F - 3 1 7 9 0 S t . S a u v e u r , F r a n c e 製 M I R 6 0 4 トウモロコシ、登録番号 C / F R / 9 6 / 0 5 / 1 0 。修飾 C r y 3 A トキシンのトランスジェニック発現により昆虫耐性が付与されたトウモロコシ。このトキシンは、カテプシン - G - タンパク分解酵素認識配列の挿入により修飾された C r y 3 A 0 5 5 である。このような形質転換トウモロコシ植物の調製は、国際公開第 0 3 / 0 1 8 8 1 0 号パンフレットに記載されている。

【 0 1 5 0 】

4 . M o n s a n t o E u r o p e S . A . 2 7 0 - 2 7 2 A v e n u e d e T e r v u r e n , B - 1 1 5 0 B r u s s e l s , B e l g i u m 製 M O N 8 6 3 トウモロコシ、登録番号 C / D E / 0 2 / 9 。 M O N 8 6 3 は、 C r y 3 B b 1 トキシンを発現し、一定の鞘翅目昆虫に対する耐性を有する。

30

【 0 1 5 1 】

5 . M o n s a n t o E u r o p e S . A . 2 7 0 - 2 7 2 A v e n u e d e T e r v u r e n , B - 1 1 5 0 B r u s s e l s , B e l g i u m 製 I P C 5 3 1 綿、登録番号 C / E S / 9 6 / 0 2 。

【 0 1 5 2 】

6 . P i o n e e r O v e r s e a s C o r p o r a t i o n , A v e n u e T e d e s c o , 7 B - 1 1 6 0 B r u s s e l s , B e l g i u m 製 1 5 0 7 トウモロコシ、登録番号 C / N L / 0 0 / 1 0 。一定の鱗翅目昆虫に対する耐性を達成するタンパク質 C r y 1 F の発現、及び、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成するための P A T タンパク質の発現のために遺伝子操作されたトウモロコシ。

40

【 0 1 5 3 】

7 . M o n s a n t o E u r o p e S . A . 2 7 0 - 2 7 2 A v e n u e d e T e r v u r e n , B - 1 1 5 0 B r u s s e l s , B e l g i u m 製 N K 6 0 3 x M O N 8 1 0 トウモロコシ、登録番号 C / G B / 0 2 / M 3 / 0 3 。遺伝子操作品種 N K 6 0 3 及び M O N 8 1 0 を交配させることによる従来交配型ハイブリッドトウモロコシ品種からなる。 N K 6 0 3 x M O N 8 1 0 トウモロコシは、アグロバクテリウム属の一種 (A

50

grobacterium sp.)の菌株CP4から得られるタンパク質CP4 EPS PSをトランスジェニック発現し、これにより、除草剤Roundup(登録商標)(グリホサートを含む)に対する耐性が付与され、また、バチルスチューリングシス(Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki)から得られるCry1Abトキシンをトランスジェニック発現し、これにより、アワノメイガを含む一定の鱗翅目に対する耐性がもたらされる。

【0154】

本明細書において用いられるところ、「生息地」という用語は、植物が成長している圃場、又は、栽培されている植物の種子が播種された圃場、又は、種子が土壤に蒔かれることとなる圃場を意味する。これは、土壤、種子及び実生、並びに、確立した植生を含む。

10

【0155】

「植物」という用語は、種子、実生、苗、根、塊茎、茎、柄、群葉及び果実を含む植物のすべての物理的な部分を指す。

【0156】

「植物繁殖体」という用語は、その増殖に用いられることが可能である種子などの植物の生殖部、及び、挿し木若しくは例えばジャガイモといった塊茎などの栄養体を表すと理解される。例えば種子(厳密な意味で)、根、果実、塊茎、鱗茎、根茎及び植物の部分が挙げられ得る。発芽後若しくは土壤から出芽した後に移植されることとなる発芽した植物及び若芽もまた挙げられる。これらの若芽は、移植前に浸漬による完全又は部分的な処置によって保護されてもよい。好ましくは、「植物繁殖体」は種子を表すと理解される。

20

【0157】

慣用名を用いて本明細書において言及される有害生物防除剤は、例えば、“The Pesticide Manual”, 15th Ed., British Crop Protection Council 2009から公知である。

【0158】

式(I)の化合物は、そのままの形態で、又は、好ましくは、配合技術分野において簡便に採用される補助剤と一緒に用いられ得る。この目的のためにこれらは、公知の様式で、乳化性濃縮物、コーティング用ペースト、直接噴射可能若しくは希釈可能な溶液又は懸濁液、希釈エマルジョン、水和剤、可溶性粉末、粉剤、粒質物、及び、例えば高分子物質中のカプセルに簡便に配合され得る。組成物のタイプと同様に、吹付け、霧吹き、散粉、散布、コーティング又は掛け流しなどの適用方法が、意図される目的及びその時点での状況に応じて選択される。組成物はまた、安定化剤、消泡剤、粘度調節剤、バインダ又は粘着剤、並びに、肥料、微量元素の供給源、又は、特別な効果を得るための他の配合物などのさらなる補助剤を含有していてもよい。

30

【0159】

例えば農業に用いられる好適なキャリア及び補助剤は、固体又は液体であることが可能であり、配合技術において有用な物質であり、例えば天然若しくは再生ミネラル物質、溶剤、分散剤、湿潤剤、粘着剤、増粘剤、バインダ又は肥料である。このようなキャリアは、例えば国際公開第97/33890号パンフレットに記載されている。

【0160】

懸濁液濃縮物は、活性な化合物の微細な固体粒子が懸濁した水性配合物である。このような配合物は沈降防止剤及び分散剤を含むと共に、活性を高めるために湿潤剤、並びに、消泡剤及び結晶成長抑制剤をさらに含み得る。使用においては、これらの濃縮物は水中で希釈され、通常は処理されるべき領域にスプレーで適用される。有効成分の量は濃縮物の0.5%~95%の範囲内であり得る。

40

【0161】

水和剤は、水又は他の液体キャリア中に容易に分散する微細粒子の形態である。これらの粒子は、固体マトリックスに保持された有効成分を含有する。典型的な固体マトリックスとしては、フーラー土、カオリンクレイ、シリカ及び他の易湿性の有機若しくは無機固形分が挙げられる。水和剤は通常、5%~95%の有効成分と少量の湿潤剤、分散剤又は

50

乳化剤とを含有する。

【0162】

乳化性濃縮物は水又は他の液体中に分散性である均質な液体組成物であって、活性な化合物と液体若しくは固体乳化剤とからのみ構成されていてもよく、又は、キシレン、高沸点芳香族ナフサ、イソホロン及び他の不揮発性有機溶剤などの液体キャリアを含有していてもよい。使用においては、これらの濃縮物は水又は他の液体中に分散され、通常は処理されるべき領域にスプレーで適用される。有効成分の量は濃縮物の0.5%~95%の範囲内であり得る。

【0163】

粒状配合物は押出物及び比較的粗大な粒子の両方を含み、通常は、処理が必要とされる領域に希釈されることなく適用される。粒状配合物に係る典型的なキャリアとしては、活性な化合物を吸収するか活性な化合物でコーティング可能である、砂、フーラー土、アタパルジャイトクレイ、ベントナイトクレイ、モンモリロナイトクレイ、パーミキュライト、パーライト、炭酸カルシウム、れんが、軽石、葉ろう石、カオリン、ドロマイト、焼き石膏、木粉、粉碎したトウモロコシ穂軸、粉碎したピーナッツの外殻、砂糖、塩化ナトリウム、硫酸ナトリウム、ナトリウムケイ酸、ホウ酸ナトリウム、マグネシア、雲母、酸化鉄、酸化亜鉛、酸化チタン、酸化アンチモン、氷晶石、石膏、珪藻土、硫酸カルシウム及び他の有機若しくは無機材料が挙げられる。粒状配合物は通常5%~25%の有効成分を含有し、これは、高沸点芳香族ナフサ、ケロシン及び他の石油留分などの表面活性剤、若しくは、植物油；並びに/又は、デキストリン、膠若しくは合成樹脂などの展着剤を含んでいてもよい。

10

20

【0164】

粉剤は、有効成分と、分散剤及びキャリアとして作用するタルク、クレイ、粉末並びに他の有機及び無機固形分などの微細固形分との易流動性の混和物である。

【0165】

マイクロカプセルは、典型的には、内包された材料を制御された速度で周囲に放出させることが可能である不活性の多孔性シェルに内包された有効成分の小滴又は顆粒である。カプセル化された小滴は、直径が典型的には1~50ミクロンである。内包された液体は典型的には、カプセルの重量の50~95%を構成し、活性な化合物に追加して溶剤を含んでいてもよい。カプセル化された顆粒は一般に、顆粒の孔部開口をシールして、液体形態の活性種を顆粒の孔部内に保持する多孔性メンブランを有する多孔性顆粒である。顆粒は典型的には、直径が1ミリメートル~1センチメートル、好ましくは1~2ミリメートルの範囲内である。顆粒は、押し出し成形、凝塊若しくはプリルによって形成されるか、又は、天然のものである。このような材料の例は、パーミキュライト、焼成クレイ、カオリン、アタパルジャイトクレイ、おがくず及び粒状炭素である。シェル又はメンブラン材料は、天然及び合成ゴム、セルロース系材料、スチレン-ブタジエンコポリマー、ポリアクリロニトリル、ポリアクリレート、ポリエステル、ポリアミド、ポリウレア、ポリウレタン及びデンブンザンデートを含む。

30

【0166】

農芸化学用途に係る他の有用な配合物は、アセトン、アルキル化ナフタレン、キシレン及び他の有機溶剤などの、所望の濃度での完全な溶解が達成される溶剤中における有効成分の単なる溶液を含む。低沸点分散剤溶剤キャリアの蒸発に伴って有効成分が微細に分離された形態に散布される加圧散布機もまた用いられ得る。

40

【0167】

上記の配合物タイプの本発明の組成物の配合に有用である好適な農業用補助剤及びキャリアは、当業者に周知である。

【0168】

利用可能である液体キャリアとしては、例えば、水、トルエン、キシレン、石油ナフサ油、作物油、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン、無水酢酸、アセトニトリル、アセトフェノン、酢酸アミル、2-ブタノン、クロロベンゼン、シクロヘキサノ、

50

シクロヘキサノール、アルキル酢酸塩、ジアセトンアルコール、1,2-ジクロロプロパン、ジエタノールアミン、p-ジエチルベンゼン、ジエチレングリコール、ジエチレングリコールアビエート、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1,4-ジオキサン、ジブロピレングリコール、ジブロピレングリコールメチルエーテル、ジブロピレングリコールジベンゾエート、ジブロキシトール、アルキルピロリジノン、酢酸エチル、2-エチルヘキサノール、エチレンカーボネート、1,1,1-トリクロロエタン、2-ヘプタノン、ピネン、d-リモネン、エチレングリコール、エチレングリコールブチルエーテル、エチレングリコールメチルエーテル、
 -ブチロラクトン、グリセロール、グリセロール二酢酸、グリセロール酢酸、グリセロールトリアセテート、ヘキサデカン、ヘキシレングリコール、酢酸イソアミル、酢酸イソボルニル、イソオクタン、イソホロン、イソプロピルベンゼン、ミリスチン酸イソプロピル、乳酸、ラウリルアミン、メシチルオキシド、メトキシ-プロパノール、メチルイソアミルケトン、メチルイソブチルケトン、ラウリン酸メチル、オクタン酸メチル、オレイン酸メチル、塩化メチレン、m-キシレン、n-ヘキサン、n-オクチルアミン、クタデカン酸、オクチルアミンアセテート、オレイン酸、オレイルアミン、o-キシレン、フェノール、ポリエチレングリコール(PEG400)、プロピオン酸、プロピレングリコール、プロピレングリコールモノメチルエーテル、p-キシレン、トルエン、リン酸トリエチル、トリエチレングリコール、キシレンスルホン酸、パラフィン、鉱油、トリクロロエチレン、パークロロエチレン、酢酸エチル、酢酸アミル、酢酸ブチル、メタノール、エタノール、イソプロパノール、及び、アミルアルコール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ヘキサノール、オクタノール等などの高分子量アルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、グリセリン及びN-メチル-2-ピロリジノンが挙げられる。濃縮物の希釈には、水が一般的に選択されるキャリアである。

10

20

【0169】

好適な固体キャリアとしては、例えば、タルク、二酸化チタン、葉ろう石クレイ、シリカ、アタパルジャイトクレイ、キースラガー、チョーク、珪藻土、石灰、炭酸カルシウム、ベントナイトクレイ、フーラー土、綿実の外殻、小麦粉、ダイズ粉、軽石、木粉、クルミの外殻粉及びリグニンが挙げられる。

【0170】

幅広い範囲の表面活性剤が、特に適用前にキャリアで希釈されるよう設計されたものといった、前記液体及び固体組成物の両方において有利に利用される。これらの表面活性剤は通常、使用される際、0.1%~15重量%の配合物を含む。これらはアニオン性、カチオン性、ノニオン性又は高分子特性であることが可能であり、乳化剤、湿潤剤、懸濁剤として、又は、他の目的のために利用されることが可能である。典型的な表面活性剤としては、ラウリル硫酸ジエタノールアンモニウムなどのアルキル硫酸塩；ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなどのアルキルアリアルスルホネート塩；ノニルフェノール-C_{sub}.18エトキシレートなどのアルキルフェノール-アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコール-C_{sub}.16エトキシレートなどのアルコール-アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウムなどの石鹸；ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウムなどのアルキルナフタレンスルホン酸塩；ジ(2-エチルヘキシル)スルホコハク酸ナトリウムなどのスルホコハク酸塩のジアルキルエステル；ソルビトールオレエートなどのソルビトールエステル；ラウリルトリメチル塩化アンモニウムなどの第4級アミン；ステアリン酸ポリエチレングリコールなどの脂肪酸のポリエチレングリコールエステル；エチレンオキシド及びプロピレンオキシドのブロックコポリマー；並びに、モノ及びジアルキルリン酸エステルの塩が挙げられる。

30

40

【0171】

農業用組成物において通例利用される他の補助剤としては、結晶化抑制剤、粘度変性剤、懸濁剤、噴霧粒調節剤、顔料、酸化防止剤、発泡剤、消泡剤、遮光剤、相溶化剤、消泡剤、金属イオン封鎖剤、中和剤及び緩衝剤、腐食抑制剤、染料、臭気剤、展着剤、浸透助

50

剤、微量元素、緩和剤、潤滑剤及び固着剤が挙げられる。

【0172】

さらに加えて、他の殺生性有効成分又は組成物を、本発明の組成物と組み合わせ、本発明の方法において用い、及び、本発明の組成物と同時に又は順次に適用してもよい。同時に適用する場合、これらのさらなる有効成分は、本発明の組成物と一緒に配合されても、又は、例えば、噴霧タンク中で一緒に混合されてもよい。これらのさらなる殺生性有効成分は、殺菌・殺カビ剤、除草剤、殺虫剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤及び/又は植物成長調節剤であり得る。

【0173】

加えて、本発明の組成物はまた、1種以上の全身獲得抵抗性誘導物質(「SAR」誘導物質)と一緒に適用され得る。SAR誘導物質は公知であって、例えば米国特許第6,919,298号明細書に記載されており、例えば、サリチル酸塩及び市販されているSAR誘導物質であるアシベンゾラル-S-メチルが挙げられる。

10

【0174】

式(I)の化合物は通常組成物の形態で用いられ、処理されるべき作物領域又は植物に、さらなる化合物と同時に、又は、順次に適用されることが可能である。これらのさらなる化合物は、例えば肥料若しくは微量元素供与物、又は、植物の成長に影響を及ぼす他の調製物であることが可能である。これらはまた、選択的な除草剤若しくは非選択的な除草剤、並びに、殺虫剤、殺菌・殺カビ剤、殺菌剤、殺線虫剤、軟体動物駆除剤であることが可能であり、又は、これらの調製物の数種の混合物であって、所望の場合には配合物の分野において慣例的に利用されるさらなるキャリア、界面活性剤若しくは適用促進補助剤を伴う混合物であることが可能である。

20

【0175】

式(I)の化合物は、有効成分として少なくとも1種の式(I)の化合物を含む、植物病原性微生物に対する防除若しくは保護のための(殺菌・殺カビ)組成物の形態で用いられ得、又は、遊離形態若しくは農芸化学的に使用可能な塩形態の上記に定義されている少なくとも1種の好ましい個別の化合物と、上記の補助剤の少なくとも1種との形態で用いられ得る。

【0176】

本発明は従って、少なくとも1種の式(I)の化合物、農学的に許容可能なキャリア、及び、任意選択により補助剤を含む、組成物、好ましくは殺菌・殺カビ組成物を提供する。農学的に許容可能なキャリアは、例えば農業用途に好適なキャリアである。農業用キャリアは技術分野において周知である。好ましくは、前記組成物は、式(I)の化合物に追加して、少なくとも1種以上の有害生物防除的に活性化化合物、例えば追加の殺菌・殺カビ性有効成分を含んでいてもよい。

30

【0177】

式(I)の化合物は、組成物における唯一の有効成分であってもよく、また、適切な場合、有害生物防除剤、殺菌・殺カビ剤、共力剤、除草剤又は植物成長調節剤などの1種以上の追加の有効成分と混合されてもよい。追加の有効成分は、いくつかの場合において、予期しない相乗的活性をもたらし得る。

40

【0178】

好適な追加の有効成分の例としては、以下が挙げられる：1,2,4-チアジアゾール、2,6-ジニトロアニリン、アシルアラニン、脂肪族窒素化合物、アミジン、アミノピリミジノール、アニリド、アニリノ-ピリミジン、アントラキノン、抗生物質、アリアル-フェニルケトン、ベンズアミド、ベンゼン-スルホンアミド、ベンズイミダゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾチオジアゾール、ベンゾチオフエン、ベンゾイルピリジン、ベンズチアジアゾール、ベンジルカルバメート、ブチルアミン、カルバメート、カルボキサミド、カプロパミド、クロロニトリル、桂皮酸アミド、銅含有化合物、シアノアセタミドオキシム、シアノアクリレート、シアノイミダゾール、シアノメチレン-チアゾリジン、ジカルボニトリル、ジカルボキサミド、ジカルボキシイミド、ジメチルスルファメート、炭

50

酸ジニトロフェノール、ジニトロフェニスル、クロトン酸ジニトロフェニル、リン酸ジフェニル、ジチノ化合物、ジチオカルバメート、ジチオエーテル、ジチオラン、エチル - アミノ - チアゾールカルボキサミド、エチル - ホスホン酸塩、フランカルボキサミド、グルコピラノシル、グルコピラノキシリル、グルタロニトリル、グアニジン、除草剤 / 植物成長調節剤、ヘキソピラノシル抗生物質、ヒドロキシ (2 - アミノ) ピリミジン、ヒドロキシシアニリド、ヒドロキシイソキサゾール、イミダゾール、イミダゾリノン、殺虫剤 / 植物成長調節剤、イソベンゾフラノン、イソキサゾリジニル - ピリジン、イソオキサゾリン、マレイミド、マンデル酸アミド、メクチン誘導体、モルホリン、ノルホリン、n - フェニルカルバメート、有機錫化合物、オキサチンカルボキサミド、オキサゾール、オキサゾリジン - ジオン、フェノール、フェノキシキノリン、フェニル - アセトアミド、フェニルアミド、フェニルベンズアミド、フェニル - オキシ - エチル - チオフェンアミド、フェニルピロール、フェニルウレア、ホスホロチオレート、リン酸、フタルアミド酸、フタルイミド、ピコリンアミド、ペペラジン、ペペリジン、植物抽出物、ポリオキシシ、プロピオンアミド、フタルイミド、ピラゾール - 4 - カルボキサミド、ピラゾリノン、ピリダジノン、ピリジン、ピリジンカルボキサミド、ピリジニル - エチルベンズアミド、ピリミジンアミン、ピリミジン、ピリミジン - アミン、ピリミジオン - ヒドラゾン、ピロリジン、ピロロキノリン、キナゾリノン、キノリン、キノリン誘導体、キノリン - 7 - カルボン酸、キノキサリン、スピロケタールアミン、ストロビルリン、スルファモイルトリアゾール、スルファミド、テトラゾリルオキシム、チアジアジン、チアジアゾールカルボキサミド、チアゾールカルボキサニド、チオシアネート、チオフェンカルボキサミド、トルアミド、

10

20

【 0 1 7 9 】

30

好適な追加の有効成分の例としては、以下も挙げられる：3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (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) - アミド、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸メトキシ - [1 - メチル - 2 - (2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) - エチル] - アミド、1 - メチル - 3 - ジフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (2 - ジクロロメチレン - 3 - エチル - 1 - メチル - インダン - 4 - イル) - アミド (1 0 7 2 9 5 7 - 7 1 - 1)、1 - メチル - 3 - ジフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (4 ' - メチルスルファニル - ビフェニル - 2 - イル) - アミド、1 - メチル - 3 - ジフルオロメチル - 4 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 [2 - (2 , 4 - ジクロロ - フェニル) - 2 - メトキシ - 1 - メチル - エチル] - アミド、(5 - クロロ - 2 , 4 - ジメチル - 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、(5 - ブロモ - 4 - クロロ - 2 - メトキシ - 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、2 - { 2 - [(E) - 3 - (2 , 6 - ジクロロ - フェニル) - 1 - メチル - プロパ - 2 - エン - (E) - イリデンアミノオキシメチル] - フェニル } - 2 - [(Z) - メトキシイミノ] - N - メチル - アセトアミド、3 - [5 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 , 3 - ジメチル - イソオキサゾリジン - 3 - イル] - ピリジン、(E) - N - メチル - 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 - イミノアセトアミド、4 - ブロモ - 2 - シアノ - N , N - ジメチル - 6 - トリフルオロメチルベンズイミダゾール - 1 - スルホンアミド、 - [N - (3 - クロロ - 2 , 6 - キシリル

40

50

) - 2 - メトキシアセトアミド] - y - ブチロラクトン、4 - クロロ - 2 - シアノ - N ,
 N - ジメチル - 5 - p - トリルイミダゾール - 1 - スルホンアミド、N - アリル - 4 , 5
 , - ジメチル - 2 - トリメチルシリルチオフェン - 3 - カルボキサミド、N - (1 - シア
 ノ - 1 , 2 - ジメチルプロピル) - 2 - (2 , 4 - ジクロロフェノキシ) プロピオンアミ
 ド、N - (2 - メトキシ - 5 - ピリジル) - シクロプロパンカルボキサミド、(. + . .
) - シス - 1 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 -
 イル) - シクロヘプタノール、2 - (1 - tert - ブチル) - 1 - (2 - クロロフェニ
 ル) - 3 - (1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) - プロパン - 2 - オール、2 ' , 6 '
 - ジブromo - 2 - メチル - 4 - トリフルオロメトキシ - 4 ' - トリフルオロメチル - 1 , 3
 - チアゾール - 5 - カルボキシアニリド、1 - イミダゾリル - 1 - (4 ' - クロロフェノキ
 シ) - 3 , 3 - ジメチルブタン - 2 - オン、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - シア
 ノフェノキシ) ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル] 3 - メトキシアクリレート、メ
 チル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - チオアミドフェノキシ) ピリミジン - 4 - イルオキ
 シ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - フ
 ルオロフェノキシ) ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレ
 ート、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 , 6 - ジフルオロフェノキシ) ピリミジン - 4
 - イルオキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3
 - (ピリミジン - 2 - イルオキシ) フェノキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレ
 ート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (5 - メチルピリミジン - 2 - イルオキシ) - フェ
 ノキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (フェ
 ニル - スルホニルオキシ) フェノキシ] フェニル - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (4 - ニトロフェノキシ) フェノキシ] フェニル] - 3 - メトキ
 シアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - フェノキシフェニル] - 3 - メトキシアクリ
 レート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 , 5 - ジメチル - ベンゾイル) ピロール - 1 - イ
 ル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - メトキシフェノキシ)
 フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 [2 - (2 - フェニルエテ
 ン - 1 - イル) - フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 , 5 - ジクロロフェノキシ) ピリジン - 3 - イル] - 3 - メトキシアクリレート、メチ
 ル (E) - 2 - (2 - (3 - (1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエトキシ) フェノキシ)
 フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - (2 - [3 - (- ヒドロ
 キシベンジル) フェノキシ] フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2
 - (2 - (4 - フェノキシピリジン - 2 - イルオキシ) フェニル) - 3 - メトキシアクリ
 レート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - n - プロピルオキシ - フェノキシ) フェニル]
 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - イソプロピルオキシフェ
 ノキシ) フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (2 -
 フルオロフェノキシ) フェノキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E)
) - 2 - [2 - (3 - エトキシフェノキシ) フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メ
 チル (E) - 2 - [2 - (4 - tert - ブチル - ピリジン - 2 - イルオキシ) フェニル
] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (3 - シアノフェノキ
 シ) フェノキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [4
 - (3 - メチル - ピリジン - 2 - イルオキシメチル) フェニル] - 3 - メトキシアクリレ
 ート、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - メチル - フェノキシ) ピリミジン - 4 - イル
 オキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (5 - プロ
 モ - ピリジン - 2 - イルオキシメチル) フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル
 (E) - 2 - [2 - (3 - (3 - ヨードピリジン - 2 - イルオキシ) フェノキシ) フェニ
 ル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - クロロピリジ
 ン - 3 - イルオキシ) ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリ
 レート、メチル (E) , (E) - 2 - [2 - (5 , 6 - ジメチルピラジン - 2 - イルメチル
 オキシイミノメチル) フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - { 2
 - [6 - (6 - メチルピリジン - 2 - イルオキシ) ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニ

10

20

30

40

50

ル} - 3 - メトキシ - アクリレート、メチル (E) , (E) - 2 - { 2 - (3 - メトキシフェニル) メチルオキシイミノメチル } - フェニル } - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - { 2 - (6 - (2 - アジドフェノキシ) - ピリミジン - 4 - イルオキシ } フェニル } - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) , (E) - 2 - { 2 - [6 - フェニルピリミジン - 4 - イル) - メチルオキシイミノメチル] フェニル } - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) , (E) - 2 - { 2 - [(4 - クロロフェニル) - メチルオキシイミノメチル] - フェニル } - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - { 2 - [6 - (2 - n - プロピルフェノキシ) - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 4 - イルオキシ] フェニル } - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) , (E) - 2 - { 2 - [(3 - ニトロフェニル) メチルオキシイミノメチル] フェニル } - 3 - メトキシアクリレート、3 - クロロ - 7 - (2 - アザ - 2 , 7 , 7 - トリメチル - オクタ - 3 - エン - 5 - イン) 、 2 , 6 - ジクロロ - N - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - ベンズアミド、3 - ヨード - 2 - プロピニルアルコール、4 - クロロフェニル - 3 - ヨードプロパルギルホルマール、3 - プロモ - 2 , 3 - ジヨード - 2 - プロペニルエチルカルバメート、2 , 3 , 3 - トリヨードアリルアルコール、3 - プロモ - 2 , 3 - ジヨード - 2 - プロペニルアルコール、3 - ヨード - 2 - プロピニル n - ブチルカルバメート、3 - ヨード - 2 - プロピニル n - ヘキシルカルバメート、3 - ヨード - 2 - プロピニルシクロヘキシル - カルバメート、3 - ヨード - 2 - プロピニルフェニルカルバメート ; フェノール誘導体、例えば、トリプロモフェノール、テトラクロロフェノール、3 - メチル - 4 - クロロフェノール、3 , 5 - ジメチル - 4 - クロロフェノール、フェノキシエタノール、ジクロロフェン、

o - フェニルフェノール、m - フェニルフェノール、p - フェニルフェノール、2 - ベンジル - 4 - クロロフェノール、5 - ヒドロキシ - 2 (5 H) - フラノン ; 4 , 5 - ジクロロジチアゾリノン、4 , 5 - ベンゾジチアゾリノン、4 , 5 - トリメチレンジチアゾリノン、4 , 5 - ジクロロ - (3 H) - 1 , 2 - ジチオール - 3 - オン、3 , 5 - ジメチル - テトラヒドロ - 1 , 3 , 5 - チアジジン - 2 - チオン、N - (2 - p - クロロベンゾイルエチル) - ヘキサミニウムクロリド、アシベンゾラル、アシペタックス、アラニカルブ、アルベンダゾール、アルジモルフ、アリシン、アリルアルコール、アメトクトラジン、アミスルプロム、アンバム、アンプロピルホス、アニラジン、アソメート、オーレオファンギン、アザコナゾール、アザフェニジン (a z a f e n d i n) 、アジチラム、アゾキシストロピン、多硫化バリウム、ベナラキシル、ベナラキシル - M、ベノダニル、ベノミル、ベンキノックス、ベントルロン、ベンチアパリカルブ、ベンチアゾール、塩化ベンザルコニウム、ベンザマクリル、ベンザモルフ、ベンゾヒドロキサム酸、ベンゾビンジフルピル、ベルベリン、ベトキサジン、ピロキサゾール、ピナパクリル、ピフェニル、ピテルタノール、ピチオノール、ピキサフェン、ブラストサイジン - S、ボスカリド、プロモタロニル、プロムコナゾール、ブピリメート、ブチオベート、ブチルアミン 多硫化カルシウム、カプタホール、カプタン、カルバモルフ、カルベンダジム、カルベンダジムクロルヒドレート、カルボキシシ、カルプロパミド、カルボン、C G A 4 1 3 9 6、C G A 4 1 3 9 7、キノメチオネート、キトサン、クロベンチアゾン、クロラニホルメタン、クロラニル、クロルフェナゾール、クロロネブ、クロロピクリン、クロロタロニル、クロロゾリネート、クロゾリネート、クリンバゾール、クロトリマゾール、クロジラコン、酢酸銅、炭酸銅、水酸化銅、ナフテン酸銅、オレイン酸銅、オキシ塩化銅、オキシキノリン酸銅、ケイ酸銅、硫酸銅、タル油酸銅、クロム酸銅亜鉛及びボルドー液などの銅含有化合物、クレゾール、クフラネブ、クプロバム、酸化第一銅、シアゾファミド、シクラフラミド、シクロヘキシミド、シフルフェナミド、シモキサニル、シペンダゾール、シプロコナゾール、シプロジニル、ダゾメット、デバカルブ、デカフェンチン、デヒドロ酢酸、ジ - 2 - ピリジルジスルフィド 1 , 1 ' - ジオキシド、ジクロフルアニド、ジクロメジン、ジクロロン、ジクロラン、ジクロロフェン、ジクロゾリン、ジクロプトラゾール、ジクロシメット、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、ジフルメトリム、O - ジ - イソ - プロピル - S - ベンジルチオホスフェート、ジメフルアゾール、ジメタクロン、ジメトコナゾール、ジメトモルフ、ジメチリモール、ジニコナゾール、ジニコナゾール - M、

10

20

30

40

50

ジノプトン、ジノカップ、ジノクトン、ジノペントン、ジノスルホン、ジノテルボン、ジ
 フェニルアミン、ジピリチオン、ジスルフィラム、ジタリムホス、ジチアノン、ジチオエ
 ーテル、ドデシルジメチルアンモニウムクロリド、ドデモルフ、ドジシン、ドジン、ドグ
 アジン、ドラゾキシロン、エジフェンホス、エネステロブリン、エポキシコナゾール、エ
 タコナゾール、エテム、エタボキサム、エチリモール、エトキシキン、エチリシン、エチ
 ル(Z) - N - ベンジル - N ([メチル(メチル - チオエチリデンアミノ - オキシカルボ
 ニル)アミノ]チオ) - アラニナト、エトリジアゾール、ファモキサドン、フェナミ
 ドン、フェナミノスルフ、フェナパニル、フェナリモル、フェンブコナゾール、フェンフ
 ラム、フェンヘキサミド、フェニトロパン、フェノキサニル、フェンピクロニル、フェン
 ピコキサミド、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、フェンピラザミン、酢酸トリフ
 ェニルスズ、水酸化トリフェニルスズ、フェルバム、フェリムゾン、フルアジナム、フル
 ジオキシニル、フルメトベル、フルモルフ、フルピコリド、フルオピラム、フルオロイミ
 ド、フルオトリマゾール、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、フルタニル、フルトラニル、フルトリアホール、フルキサピロキサ
 ド、ホルベット、ホルムアルデヒド、ホセチル、フベリダゾール、フララキシル、フラメ
 トピル、フルカルバニル、フルコナゾール、フルフラール、フルメシクロックス、フロフ
 ザネート、グリオジン、グリセオフルビン、グアザチン、ハラクリネート、ヘキサクロロ
 ベンゼン、ヘキサクロロブタジエン、ヘキサクロロフェン、ヘキサコナゾール、ヘキシル
 チオホス、ヒドラルガフェン、ヒドロキシイソオキサゾール、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、三酢酸イミノクタジン、イ
 ネジン、ヨードカルブ、イブコナゾール、イブフェントリフルコナゾール、イプロベンホ
 ス、イプロジオン、イプロバリカルブ、イソプロパニルブチルカルバメート、イソプロチ
 オラン、イソピラザム、イソチアニル、イソバレジオン、イソパムホス、カスガマイシン
 、クレソキシム - メチル、LY186054、LY211795、LY248908、マ
 ンコゼブ、マンジプロパミド、マネブ、メベニル、メカルピンジド、メフェノキサム、メ
 フェントリフルコナゾール、メパニピリム、メプロニル、塩化第二水銀、塩化第一水銀、
 メブチルジノカップ、メタラキシル、メタラキシル - M、メタム、メタゾキシロン、メト
 コナゾール、メタスルホカルブ、メタフロキサム、臭化メチル、ヨウ化メチル、メチルイ
 ソチオシアネート、メチラム、メチラム - 亜鉛、メトミノストロビン、メトラフェノン、
 メツルホバクス、ミルネブ、モロキシジン、ミクロブタニル、ミクロゾリン、ナーバム、
 ナタマイシン、ネオアソジン、ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、ニトロスチレン、
 ニトロタール - イソ - プロピル、ヌアリモル、オクチリノン、オフレース、有機水銀化合
 物、オリザストロビン、オストール、オキサジキシル、オキサスルフロニ、オキサチアピ
 プロリン、オキシニン銅、オキシリン酸、オキシボコナゾール、オキシカルボキシニン、パリ
 ノール、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、ペンチオピラド、フェナマクリル、フェナジンオキシド、ホスジフェン、
 ホセチル - A1、リン酸、フタリド、ピコキシストロビン、ピペラリン、ポリカルバメー
 ト、ポリオキシニンD、ポリオキシリム、ポリラム、プロベナゾール、プロクロラズ、プロ
 シミドン、プロパミジン、プロパモカルブ、プロピコナゾール、プロピネブ、プロピオン
 酸、プロキナジド、プロチオカルブ、プロチオコナゾール、ピジフルメトフェン、ピラカ
 ルポリド、ピラクロストロビン、ピラメトロストロビン、ピラオキシストロビン、ピラゾ
 ホス、ピリベンカルブ、ピリジニトリル、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピリオフェ
 ノン、ピロキロン、ピロキシクロール、ピロキシフル、ピロールニトリン、第四級アンモ
 ニウム化合物、キナセトール、キナザミド、キンコナゾール、キノメチオネート、キノキ
 シフェン、キントゼン、ラベンザゾール、サントニン、セダキサシ、シルチオフアム、シ
 メコナゾール、シブコナゾール、五塩化石炭酸ナトリウム、スピロキサミン、ストレプト
 マイシン、硫黄、スルトロペン、テブコナゾール、テブフロキン、テクロフタラム、テク
 ナゼン、テコラム、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チアジフロル、チシオフエン
 、チフルザミド、2 - (チオシアノメチルチオ)ベンゾチアゾール、チオフアネート - メ
 チル、チオキノックス、チラム、チアジニル、チミベンコナゾール、チオキシミド、トル

10

20

30

40

50

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、トリアミホス、トリアリモール、トリアズブチル、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、トリフルマゾール、トリホリン、トリフルミゾール、トリチコナゾール、ウニコナゾール、ウルバシド、バリダマイシン、バリフェナレート、ババム、ピンクロゾリン、ザリルアミド、ジネブ、ジラム、及びゾキサミド。

【0180】

本発明の化合物はまた、駆虫薬薬剤との組み合わせで用いられ得る。このような駆虫薬としては、欧州特許第357460号明細書、欧州特許第444964号明細書及び欧州特許第594291号明細書に記載されているとおり、イベルメクチン、アベルメクチン、アバメクチン、エマメクチン、エブリノメクチン、ドラメクチン、セラメクチン、モキシデクチン、ネマデクチン及びミルベマイシン誘導体などの化合物の大環式ラクトンクラスから選択される化合物が挙げられる。追加の駆虫薬としては、米国特許第5015630号明細書、国際公開第9415944号及び国際公開第9522552号に記載されているものなどの半合成及び生合成アベルメクチン/ミルベマイシン誘導体が挙げられる。追加の駆虫薬としては、アルベンダゾール、カンベンダゾール、フェンベンダゾール、フルベンダゾール、メベンダゾール、オクスフェンダゾール、オキシベンダゾール、パーベンダゾール、及びこのクラスの他の構成要素などのベンズイミダゾールが挙げられる。追加の駆虫薬としては、テトラミゾール、レバミゾール、パモ酸ピランテル、オキサテル又はモランテルなどの、イミダゾチアゾール及びテトラヒドロピリミジンが挙げられる。追加の駆虫薬としては、トリクラベンダゾール及びクロルスロンなどのフルキシド、並びにプラジカンテル及びエプシプランテルなどのセストサイド (c e s t o c i d e) が挙げられる。

10

20

【0181】

本発明の化合物は、パラヘルクアミド/マルクホルチンクラスの駆虫薬の誘導体及び類似体、並びに米国特許第5478855号明細書、米国特許第4639771号明細書及び独国特許第19520936号明細書に開示されているものなどの抗寄生虫性オキサゾリンとの組み合わせで用いられ得る。

【0182】

本発明の化合物は、国際公開第96/15121号に記載されている一般的なクラスのジオキソモルホリン抗寄生虫性薬剤の誘導体及び類似体との組み合わせで、また、国際公開第96/11945号、国際公開第93/19053号、国際公開第93/25543号、欧州特許第0626375号明細書、欧州特許第0382173号明細書、国際公開第94/19334号、欧州特許第0382173号明細書、及び欧州特許第0503538号明細書に記載されているものなどの駆虫活性環状デブシペプチドとの組み合わせで用いられ得る。

30

【0183】

本発明の化合物は、他の外寄生生物撲滅薬；例えば、フィプロニル；ピレスロイド；有機リン酸エステル；ルフェヌロンなどの昆虫成長調節剤；テブフェノジドなどのエクジソンアゴニスト；イミダクロプリドなどのネオニコチノイドとの組み合わせで用いられ得る。

【0184】

本発明の化合物は、テルペンアルカロイド、例えば国際特許出願公開番号国際公開第95/19363号又は国際公開第04/72086号に記載のもの、特に、これらに開示される化合物との組み合わせで用いられ得る。

40

【0185】

本発明の化合物が組み合わせられて用いられ得るこのような生物学的に活性な化合物の他の例としては、限定はされないが、以下が挙げられる。

有機リン酸エステル：アセフェート、アザメチホス、アジンホス - エチル、アジンホス - メチル、プロモホス、プロモホス - エチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルピリホス、クロルフエンピンホス、クロルメホス、デメトン、デメトン - S - メチル、デメトン - S - メチルスルホン、ジアリホス、ジアジノン、ジクロルボス、ジクロトホス、

50

ジメトエート、ジスルホトン、エチオン、エトプロホス、エトリムホス、ファンファー、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンスルホチオン、フェンチオン、フルピラゾホス、ホノホス、ホルモチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イサゾホス、イソチオエート、イソキサチオン、マラチオン、メタクリホス、メタミドホス、メチダチオン、メチル-パラチオン、メピンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシデメトン-メチル、パラオキシオン、パラチオン、パラチオン-メチル、フェントエート、ホサロン、ホスホラン、ホスホカルブ、ホスメット、ホスファミドン、ホレート、ホキシム、ピリミホス、ピリミホス-メチル、プロフェノホス、プロパホス、プロエタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルプロホス、テムホス、テルブホス、テブピリムホス、テトラクロルピンホス、チメトン (thimeton)、トリアゾホス、トリクロルホン、バミドチオン。

10

【0186】

カルバメート：アラニカルブ、アルジカルブ、2 - sec - ブチルフェニルメチルカルバメート、ベンフラカルブ、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、クロエトカルブ、エチオフェンカルブ、フェノキシカルブ、フェノチオカルブ、フラチオカルブ、HCN - 801、イソプロカルブ、インドキサカルブ、メチオカルブ、メトミル、5 - メチル - m - クメニルブチリル (メチル) カルバメート、オキサミル、ピリミカルブ、プロボクサー、チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、UC - 51717。

【0187】

ピレスロイド：アクリナチン (acrinathin)、アレトリン、アルファメトリン (alphametrin)、5 - ベンジル - 3 - フリルメチル (E) - (1 R) - シス - 2, 2 - ジメチル - 3 - (2 - オキソチオラン - 3 - イリデンメチル) シクロプロパンカルボキシレート、ピフェントリン、 - シフルトリン、シフルトリン、a - シペルメトリン、 - シペルメトリン、ピオアレトリン、ピオアレトリン ((S) - シクロペンチル異性体)、ピオレスメトリン、ピフェントリン、NCI - 85193、シクロプロトリン、シハロトリン、シチトリン、シフェノトリン、デルタメトリン、エンペントリン、エスフェンバレレート、エトフェンプロクス、フェンフルトリン、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、フルバリネート (D 異性体)、イミプロトリン、シハロトリン、 - シハロトリン、ペルメトリン、フェノトリン、プラレトリン、ピレトリン (天然産物)、レスメトリン、テトラメトリン、トランスフルトリン、 - シペルメトリン、シラフルオフエン、t - フルバリネート、テフルトリン、トラロメトリン、 - シペルメトリン。

20

30

【0188】

節足動物成長調節剤：a) キチン合成阻害剤：ベンゾイル尿素：クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルアズロン、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、ルフェヌロン、ノバルロン、テフルベンズロン、トリフルムロン、ブプロフェジン、ジオフェノラン、ヘキシチアゾクス、エトキサゾール、クロロフェンタジン；b) エクジソンアンタゴニスト：ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テブフェノジド；c) ジュベノイド：ピリプロキシフェン、メトブレン (S - メトブレンを含む)、フェノキシカルブ；d) 脂質生合成阻害剤：スピロジクロフェン。

40

【0189】

他の抗寄生虫薬：アセキノシル、アミトラズ、AKD - 1022、ANS - 118、アザジラクチン、バチルスチューリングゲンシス (Bacillus thuringiensis)、ベンスタップ、ピフェナゼート、ピナバクリル、プロモプロピレート、BTG - 504、BTG - 505、カンフェクロル、カルタップ、クロロベンジレート、クロルジメホルム、クロルフェナビル、クロマフェノジド、クロチアニジン、シロマジン、ジアクロデン、ジアフェンチウロン、DBI - 3204、ジナクチン、ジヒドロキシメチルジヒドロキシピロリジン、ジノプトン、ジノカップ、エンドスルファン、エチプロール、エトフェンプロクス、フェナザキン、フルマイト、MTI - 800、フェンピロキシメート、フルアクリピリム、フルベンジミン、フルプロシトリネート、フルフェンジン、フル

50

フェンプロックス、フルプロキシフェン、ハロフェンプロックス (halofenpro
x)、ヒドラメチルノン、IKI-220、カネマイト、NC-196、ニームガード、
ニジノルテルフラン、ニテンピラム、SD-35651、WL-108477、ピリダリ
ル、プロパルギット、プロトリフェンビュート、ピメトロジン (pymethroz
ine)、ピリダベン、ピリミジフェン、NC-1111、R-195、RH-0345、R
H-2485、RYI-210、S-1283、S-1833、SI-8601、シラフ
ルオフェン、シロマジン、スピノサド、テブフェンピラド、テトラジホン、テトラナクチ
ン、チアクロプリド、チオシクラム、チアメトキサム、トルフェンピラド、トリアザメー
ト、トリエトキシスピノシン、トリアクチン、ベルブチン、ベルタレク、YI-5301。
【0190】

生物剤：パチルスチューリングゲンシス亜種アイザワイ、クルスターキ (Bacillu
s thuringiensis ssp aizawai, kurstaki)、パチル
スチューリングゲンシス (Bacillus thuringiensis) エンドトキ
シン、バキュロウイルス、昆虫病原性バクテリア、ウイルス及び真菌。

【0191】

殺菌剤：クロルテトラサイクリン、オキシテトラサイクリン、ストレプトマイシン。

【0192】

他の生物剤：エンロフロキサシン、フェバンテル、ペネタマート、メロキシカム、セフ
アレキシン、カナマイシン、ピモベンダン、クレンブテロール、オメプラゾール、チアム
リン、ベナゼプリル、ピリプロール、セフキノム、フロルフェニコール、ブセレリン、セ
フォベシン、ツラスロマイシン、セフチオウル、カルプロフェン、メタフルミゾン、プラ
ジクアランテル、トリクラベンダゾール。

【0193】

式 (I) の化合物と有効成分との以下の混合物が好ましい。「TX」という略記は、表
A1~A8 (上記) 又は表E (下記) に示される化合物からなる群から選択される1つの
化合物を意味する。

石油 (代替名) (628) + TX からなる物質の群から選択される補助剤、

1, 1 - ビス (4 - クロロフェニル) - 2 - エトキシエタノール (IUPAC名) (91
0) + TX、2, 4 - ジクロロフェニルベンゼンスルホネート (IUPAC / ケミカルア
ブストラクツ名) (1059) + TX、2 - フルオロ - N - メチル - N - 1 - ナフチルア
セドアミド (IUPAC名) (1295) + TX、4 - クロロフェニルフェニルスルホン
(IUPAC名) (981) + TX、アバメクチン (1) + TX、アセキノシル (3) +
TX、アセトプロール [CCN] + TX、アクリナトリン (9) + TX、アルジカルブ (16)
+ TX、アルドキシカルブ (863) + TX、シベルメトリン (202) + TX、
アミジチオン (870) + TX、アミドフルメト [CCN] + TX、アミドチオエー
ト (872) + TX、アミトン (875) + TX、シュウ酸水素アミトン (875) + TX、
アミトラズ (24) + TX、アラマイト (881) + TX、三酸化ヒ素 (882) +
TX、AVI 382 (化合物コード) + TX、AZ 60541 (化合物コード) + TX
、アジンホス - エチル (44) + TX、アジンホス - メチル (45) + TX、アゾベンゼ
ン (IUPAC名) (888) + TX、アゾシクロチン (46) + TX、アゾトエート (889)
+ TX、ベノミル (62) + TX、ベノキサホス (代替名) [CCN] + TX、
ベンゾキシメート (71) + TX、ベンジル安息香酸塩 (IUPAC名) [CCN] + TX、
ピフェナゼート (74) + TX、ピフェントリン (76) + TX、ピナパクリル (9
07) + TX、プロフェンバレレート (代替名) + TX、プロフラニリド [120772
7 - 04 - 5] + TX、プロモシクレン (918) + TX、プロモホス (920) + TX
、プロモホス - エチル (921) + TX、プロモプロピレート (94) + TX、ブプロフ
ェジン (99) + TX、プトカルボキシム (103) + TX、プトキシカルボキシム (1
04) + TX、プチルピリダベン (代替名) + TX、多硫化カルシウム (IUPAC名)
(111) + TX、カンフェクロル (941) + TX、カーボノレート (943) + TX
、カルバリル (115) + TX、カルボフラン (118) + TX、カルボフェノチオン (

10

20

30

40

50

947) + TX、CGA 50'439 (開発コード) (125) + TX、キノメチオナト
 (126) + TX、クロルベンシド (959) + TX、クロルジメホルム (964) + TX
 X、クロルジメホルム塩酸塩 (964) + TX、クロルフェナビル (130) + TX、ク
 ロルフェネトール (968) + TX、クロルフェンソン (970) + TX、クロルフェン
 スルフィド (971) + TX、クロルフェンビンホス (131) + TX、クロロベンジレ
 ート (975) + TX、クロロメブホルム (977) + TX、クロロメチウロン (978
) + TX、クロロプロピレート (983) + TX、クロルピリホス (145) + TX、ク
 ロルピリホス - メチル (146) + TX、クロルチオホス (994) + TX、シネリン I
 (696) + TX、シネリン II (696) + TX、シネリン (696) + TX、クロフ
 エンテジン (158) + TX、クロサンテル (代替名) [CCN] + TX、クマホス (1
 74) + TX、クロタミトン (代替名) [CCN] + TX、クロトキシホス (1010)
 + TX、クフラネブ (1013) + TX、シアントエート (1020) + TX、シフルメ
 トフェン (CAS登録番号: 400882-07-7) + TX、シハロトリン (196)
 + TX、シヘキサチン (199) + TX、シベルメトリン (201) + TX、DCPM (1
 032) + TX、DDT (219) + TX、デメフィオン (1037) + TX、デメフ
 イオン - O (1037) + TX、デメフィオン - S (1037) + TX、デメトン (10
 38) + TX、デメトン - メチル (224) + TX、デメトン - O (1038) + TX、
 デメトン - O - メチル (224) + TX、デメトン - S (1038) + TX、デメトン -
 S - メチル (224) + TX、デメトン - S - メチルスルホン (1039) + TX、ジ
 アフェンチウロン (226) + TX、ジアリホス (1042) + TX、ジアジノン (227
) + TX、ジクロフルアニド (230) + TX、ジクロルボス (236) + TX、ジクリ
 ホス (代替名) + TX、ジコホル (242) + TX、ジクロトホス (243) + TX、ジ
 エノクロル (1071) + TX、ジメホックス (1081) + TX、ジメトエート (26
 2) + TX、ジナクチン (代替名) (653) + TX、ジネクス (1089) + TX、ジ
 ネクスジクレキシソ (1089) + TX、ジノプトン (269) + TX、ジノカップ (2
 70) + TX、ジノカップ - 4 [CCN] + TX、ジノカップ - 6 [CCN] + TX、ジ
 ノクトン (1090) + TX、ジノペントン (1092) + TX、ジノスルホン (109
 7) + TX、ジノテルボン (1098) + TX、ジオキサチオン (1102) + TX、ジ
 フェニルスルホン (IUPAC名) (1103) + TX、ジスルフィラム (代替名) [C
 CN] + TX、ジスルホトン (278) + TX、DNOC (282) + TX、ドフェナピ
 ン (1113) + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、エンドスルファン (2
 94) + TX、エンドチオン (1121) + TX、EPN (297) + TX、エブリノ
 メクチン (代替名) [CCN] + TX、エチオン (309) + TX、エトエートメチル (1
 134) + TX、エトキサゾール (320) + TX、エトリムホス (1142) + TX
 、フェナザフロル (1147) + TX、フェナザキン (328) + TX、酸化フェンブタ
 スズ (330) + TX、フェノチオカルブ (337) + TX、フェンプロパトリン (34
 2) + TX、フェンピラド (代替名) + TX、フェンピロキシメート (345) + TX、
 フェンソン (1157) + TX、フェントリファニル (1161) + TX、フェンバレレ
 ート (349) + TX、フィプロニル (354) + TX、フルアクリピリム (360) +
 TX、フルアズロン (1166) + TX、フルベンジミン (1167) + TX、フルシク
 ロクスロン (366) + TX、フルシトリネート (367) + TX、フルエネチル (11
 69) + TX、フルフェノクスロン (370) + TX、フルメトリン (372) + TX、
 フルオルベンシド (1174) + TX、フルバリネート (1184) + TX、FMC 1
 137 (開発コード) (1185) + TX、ホルメタネート (405) + TX、ホルメタ
 ネート塩酸塩 (405) + TX、ホルモチオン (1192) + TX、ホルムパラネート (1
 193) + TX、 - HCH (430) + TX、グリオジン (1205) + TX、ハル
 フェンプロックス (424) + TX、ヘプテノホス (432) + TX、ヘキサデシルシク
 ロプロパンカルボキシレート (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1216) +
 TX、ヘキシチアゾクス (441) + TX、ヨードメタン (IUPAC名) (542) +
 TX、イソカルボホス (代替名) (473) + TX、イソプロピルO - (メトキシアミノ

10

20

30

40

50

チオホスホリル) サリチレート (IUPAC名) (473) + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、ジャスモリン I (696) + TX、ジャスモリン II (696) + TX、ヨードフェンホス (1248) + TX、リンダン (430) + TX、ルフェヌロン (490) + TX、マラチオン (492) + TX、マロノベン (1254) + TX、メカルバム (502) + TX、メホスホラン (1261) + TX、メスルフェン (代替名) [CCN] + TX、メタクリホス (1266) + TX、メタミドホス (527) + TX、メチダチオン (529) + TX、メチオカルブ (530) + TX、メトミル (531) + TX、臭化メチル (537) + TX、メトルカルブ (550) + TX、メビンホス (556) + TX、メキサカルベート (1290) + TX、ミルベメクチン (557) + TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX、ミバホックス (1293) + TX、モノクロトホス (561) + TX、モルホチオン (1300) + TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] + TX、ナレド (567) + TX、NC - 184 (化合物コード) + TX、NC - 512 (化合物コード) + TX、ニフルリジド (1309) + TX、ニコマイシン (代替名) [CCN] + TX、ニトリラカルブ (1313) + TX、ニトリラカルブ 1 : 1 塩化亜鉛錯体 (1313) + TX、NNI - 0101 (化合物コード) + TX、NNI - 0250 (化合物コード) + TX、オメトエート (594) + TX、オキサミル (602) + TX、オキシデプロホス (1324) + TX、オキシジスルホトン (1325) + TX、pp' - DDT (219) + TX、パラチオン (615) + TX、ペルメトリン (626) + TX、石油 (代替名) (628) + TX、フェンカプトン (1330) + TX、フェントエート (631) + TX、ホレート (636) + TX、ホサロン (637) + TX、ホスホラン (1338) + TX、ホスメット (638) + TX、ホスファミドン (639) + TX、ホキシム (642) + TX、ピリミホス - メチル (652) + TX、ポリクロロテルペン (慣習名) (1347) + TX、ポリナクチン (代替名) (653) + TX、プロクロノール (1350) + TX、プロフェノホス (662) + TX、プロマシル (1354) + TX、プロパルギット (671) + TX、プロベタンホス (673) + TX、プロボクサー (678) + TX、プロチダチオン (1360) + TX、プロトエート (1362) + TX、ピレトリン I (696) + TX、ピレトリン II (696) + TX、ピレトリン (696) + TX、ピリダベン (699) + TX、ピリダフェンチオン (701) + TX、ピリミジフェン (706) + TX、ピリミテート (1370) + TX、キナルホス (711) + TX、キンチオキス (1381) + TX、R - 1492 (開発コード) (1382) + TX、RA - 17 (開発コード) (1383) + TX、ロテノン (722) + TX、シュラーダン (1389) + TX、セブホス (代替名) + TX、セラメクチン (代替名) [CCN] + TX、SI - 0009 (化合物コード) + TX、ソファミド (1402) + TX、スピロジクロフェン (738) + TX、スピロメシフェン (739) + TX、SSI - 121 (開発コード) (1404) + TX、スルフィラム (代替名) [CCN] + TX、スルフルアミド (750) + TX、スルホテップ (753) + TX、硫黄 (754) + TX、SZI - 121 (開発コード) (757) + TX、-フルバリネート (398) + TX、テブフェンピラド (763) + TX、TEPP (1417) + TX、テルバム (代替名) + TX、テトラクロルピンホス (777) + TX、テトラジホン (786) + TX、テトラナクチン (代替名) (653) + TX、テトラスル (1425) + TX、チアフェノックス (代替名) + TX、チオカルボキシム (1431) + TX、チオファノックス (800) + TX、チオメトン (801) + TX、チオキノックス (1436) + TX、ツリンギエンシン (代替名) [CCN] + TX、トリアミホス (1441) + TX、トリアラテン (1443) + TX、トリアゾホス (820) + TX、トリアズロン (代替名) + TX、トリクロルホン (824) + TX、トリフェノホス (1455) + TX、トリアクチン (代替名) (653) + TX、バミドチオン (847) + TX、バニリプロール [CCN] 及び YI - 5302 (化合物コード) + TX からなる物質の群から選択される殺ダニ剤、
 ベトキサジン [CCN] + TX、ニオクタン酸銅 (IUPAC名) (170) + TX、硫酸銅 (172) + TX、シブトリン [CCN] + TX、ジクロン (1052) + TX、ジ

10

20

30

40

50

クロロフェン(232)+TX、エンドタール(295)+TX、フェンチン(347)+TX、消石灰[CCN]+TX、ナーバム(566)+TX、キノクラミン(714)+TX、キノナミド(1379)+TX、シマジン(730)+TX、酢酸トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)及び水酸化トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)+TXからなる物質の群から選択される殺藻剤、

アバメクチン(1)+TX、クルホメート(1011)+TX、ドラメクチン(代替名)[CCN]+TX、エマメクチン(291)+TX、エマメクチン安息香酸塩(291)+TX、エプリノメクチン(代替名)[CCN]+TX、イベルメクチン(代替名)[CCN]+TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN]+TX、モキシデクチン(代替名)[CCN]+TX、ピペラジン[CCN]+TX、セラメクチン(代替名)[CCN]+TX、スピノサド(737)及びチオファネート(1435)+TXからなる物質の群から選択される駆虫薬、

10

クロラロース(127)+TX、エンドリン(1122)+TX、フェンチオン(346)+TX、ピリジン-4-アミン(IUPAC名)(23)及びストリキニーネ(745)+TXからなる物質の群から選択される殺鳥剤、

1-ヒドロキシ-1H-ピリジン-2-チオン(IUPAC名)(1222)+TX、4-(キノキサリン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド(IUPAC名)(748)+TX、硫酸8-ヒドロキシキノリン(446)+TX、プロノポール(97)+TX、ニオクタン酸銅(IUPAC名)(170)+TX、水酸化銅(IUPAC名)(169)+TX、クレゾール[CCN]+TX、ジクロロフェン(232)+TX、ジピリチオン(1105)+TX、ドジシン(1112)+TX、フェナミノスルフ(1144)+TX、ホルムアルデヒド(404)+TX、ヒドラルガフェン(代替名)[CCN]+TX、カスガマイシン(483)+TX、カスガマイシン塩酸塩水和物(483)+TX、ニッケルピス(ジメチルジチオカルバメート)(IUPAC名)(1308)+TX、ニトラピリン(580)+TX、オクチリノン(590)+TX、オキシリン酸(606)+TX、オキシテトラサイクリン(611)+TX、硫酸ヒドロキシキノリンカリウム(446)+TX、プロベナゾール(658)+TX、ストレプトマイシン(744)+TX、ストレプトマイシンセスキスルフェート(744)+TX、テクロフタラム(766)+TX、及びチオメルサール(代替名)[CCN]+TXからなる物質の群から選択される殺菌剤、

20

30

リンゴコカクモンハマキ(*Adoxophyes orana*)GV(代替名)(12)+TX、アグロバクテリウムラジオバクター(*Agrobacterium radiobacter*)(代替名)(13)+TX、ムチカブリダニ属(*Amblyseius* spp.)(代替名)(19)+TX、アナグラファファルシフェラ(*Anagrapa falcifera*)NPV(代替名)(28)+TX、アングルスアトムス(*Anagrus atomus*)(代替名)(29)+TX、アブラコバチ(*Aphelinus abdominalis*)(代替名)(33)+TX、コレマンアブラバチ(*Aphidius colemani*)(代替名)(34)+TX、ショクガタマバエ(*Aphidoletes aphidimyza*)(代替名)(35)+TX、オートグラフアカリホルニカ(*Autographa californica*)NPV(代替名)(38)+TX、バチルスフィルムス(*Bacillus firmus*)(代替名)(48)+TX、バチルススファエリクスネイデ(*Bacillus sphaericus* Neide)(学名)(49)+TX、バチルスチューリンゲンシスベルリナー(*Bacillus thuringiensis* Berliner)(学名)(51)+TX、バチルスチューリンゲンシス亜種アイザワイ(*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*)(学名)(51)+TX、バチルスチューリンゲンシス亜種イスラエレンシス(*Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*)(学名)(51)+TX、バチルスチューリンゲンシス亜種ヤポネンシス(*Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis*)(学名)(51)+TX、バチルスチューリンゲンシス亜種クルスターキ

40

50

(*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリンゲンシス亜種テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*) (学名) (51) + TX、ビューベリアバシアナ (*Beauveria bassiana*) (代替名) (53) + TX、ビューベリアブロングニアルティ (*Beauveria brongniartii*) (代替名) (54) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (代替名) (151) + TX、ツマアカオオテントウムシ (*Cryptolaemus montrouzieri*) (代替名) (178) + TX、コドリガ (*Cydia pomonella*) GV (代替名) (191) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) (代替名) (212) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (代替名) (254) + TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (学名) (293) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (代替名) (300) + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) NPV (代替名) (431) + TX、ヘテロルハブジチスバクテリオホラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) 及び H. メギジス (*H. megidis*) (代替名) (433) + TX、サカハチテントウ (*Hippodamia convergens*) (代替名) (442) + TX、フジコナヒゲナガトビコバチ (*Leptomastix dactylopii*) (代替名) (488) + TX、マクロロフスカリジノサス (*Macrolophus caliginosus*) (代替名) (491) + TX、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*) NPV (代替名) (494) + TX、メタフィクスヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) (代替名) (522) + TX、メタリジウムアニソプリアエ変種アクリズム (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) (学名) (523) + TX、メタリジウムアニソプリアエ変種アニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) (学名) (523) + TX、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer*) NPV 及び N. レコンテイ (*N. lecontei*) NPV (代替名) (575) + TX、ヒメハナカメムシ属 (*Orius* spp.) (代替名) (596) + TX、パエシロマイセスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (代替名) (613) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (代替名) (644) + TX、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) マルチカブシド核多角体ウイルス (学名) (741) + TX、ステイネルネマビビオニス (*Steinernema bibionis*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマカルポカプサエ (*Steinernema carpocapsae*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマフェルチアエ (*Steinernema feltiae*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマグラセリ (*Steinernema glaseri*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマリオブラベ (*Steinernema riobrave*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマリオブラビス (*Steinernema riobravise*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマスカプテリスキ (*Steinernema scaptoterisci*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマ属 (*Steinernema* spp.) (代替名) (742) + TX、トリコグラマ属 (*Trichogramma* spp.) (代替名) (826) + TX、チフロドロムスオクシデンタリス (*Typhlodromus occidentalis*) (代替名) (844) 及びベルチシリウムレカニイ (*Verticillium lecanii*) (代替名) (848) + TX、枯草菌変種アミロリケファシエンス (*Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens*) 菌株 FZB24 (Novozymes Biologicals Inc. (5400 Corporate Circle, Salem, VA 24153, U.S.A.) から入手可能であり、商標 Taegro (登録商標) で知られている) + TX からなる物質の群から選択される生物剤、

10

20

30

40

50

ヨードメタン (IUPAC名) (542) 及び臭化メチル (537) + TX からなる物質の群から選択される土壌滅菌剤、

アホレート [CCN] + TX、ピサジル (代替名) [CCN] + TX、ブスルファン (代替名) [CCN] + TX、ジフルベンズロン (250) + TX、ジマチフ (代替名) [CCN] + TX、ヘメル [CCN] + TX、ヘムパ [CCN] + TX、メテパ [CCN] + TX、メチオテパ [CCN] + TX、メチルアホレート [CCN] + TX、モルジド [CCN] + TX、ペンフルロン (代替名) [CCN] + TX、テパ [CCN] + TX、チオヘムパ (代替名) [CCN] + TX、チオテパ (代替名) [CCN] + TX、トレタミン (代替名) [CCN] 及びウレデパ (代替名) [CCN] + TX からなる物質の群から選択される不妊化剤、

(E) - デカ - 5 - エン - 1 - イルアセテートを伴う (E) - デカ - 5 - エン - 1 - オール (IUPAC名) (222) + TX、(E) - トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (829) + TX、(E) - 6 - メチルヘプタ - 2 - エン - 4 - オール (IUPAC名) (541) + TX、(E, Z) - テトラデカ - 4, 10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (779) + TX、(Z) - ドデカ - 7 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (285) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エナール (IUPAC名) (436) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (437) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 13 - エン - 11 - イン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (438) + TX、(Z) - イコサ - 13 - エン - 10 - オン (IUPAC名) (448) + TX、(Z) - テトラデカ - 7 - エン - 1 - アール (IUPAC名) (782) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - オール (IUPAC名) (783) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (784) + TX、(7E, 9Z) - ドデカ - 7, 9 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (283) + TX、(9Z, 11E) - テトラデカ - 9, 11 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (780) + TX、(9Z, 12E) - テトラデカ - 9, 12 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (781) + TX、14 - メチルオクタデカ - 1 - エン (IUPAC名) (545) + TX、4 - メチルノナン - 5 - オールを伴う 4 - メチルノナン - 5 - オン (IUPAC名) (544) + TX、 - マルチストリアチン (代替名) [CCN] + TX、ブレビコミン (代替名) [CCN] + TX、コドレルア (代替名) [CCN] + TX、コドレモン (代替名) (167) + TX、クエルレ (代替名) (179) + TX、ディスパールア (277) + TX、ドデカ - 8 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (286) + TX、ドデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (287) + TX、ドデカ - 8 + TX、10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (284) + TX、ドミニカルア (代替名) [CCN] + TX、エチル 4 - メチルオクタノエート (IUPAC名) (317) + TX、オイゲノール (代替名) [CCN] + TX、フロントリン (代替名) [CCN] + TX、ゴシッブルア (代替名) (420) + TX、グランドルア (421) + TX、グランドルア I (代替名) (421) + TX、グランドルア II (代替名) (421) + TX、グランドルア III (代替名) (421) + TX、グランドルア IV (代替名) (421) + TX、ヘキサルア [CCN] + TX、イブスジエノール (代替名) [CCN] + TX、イブセノール (代替名) [CCN] + TX、ジャボニルア (代替名) (481) + TX、リネアチン (代替名) [CCN] + TX、リトルア (代替名) [CCN] + TX、ルーブルア (代替名) [CCN] + TX、メドルア [CCN] + TX、メガトモ酸 (代替名) [CCN] + TX、メチルオイゲノール (代替名) (540) + TX、ムスカルア (563) + TX、オクタデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (588) + TX、オクタデカ - 3, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (589) + TX、オルフラルア (代替名) [CCN] + TX、オリクタールア (代替名) (317) + TX、オストラモン (代替名) [CCN] + TX、シグルア [CCN] + TX、ソルジジン (代替名) (736) + TX、スルカトール (代替名) [CCN] + TX、テトラデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (785) + T

10

20

30

40

50

X、トリメドルア(839)+TX、トリメドルアA(代替名)(839)+TX、トリメドルアB₁(代替名)(839)+TX、トリメドルアB₂(代替名)(839)+TX、トリメドルアC(代替名)(839)及びトランクコール(代替名)[CCN]+TXからなる物質の群から選択される昆虫フェロモン、

2-(オクチルチオ)エタノール(IUPAC名)(591)+TX、ブトピロノキシル(933)+TX、ブトキシ(ポリプロピレングリコール)(936)+TX、アジピン酸ジブチル(IUPAC名)(1046)+TX、フタル酸ジブチル(1047)+TX、コハク酸ジブチル(IUPAC名)(1048)+TX、ジエチルトルアミド[CCN]+TX、ジメチルカルベート[CCN]+TX、フタル酸ジメチル[CCN]+TX、エチルヘキサジオール(1137)+TX、ヘキサアミド[CCN]+TX、メトキンブチル(1276)+TX、メチルネオデカンアミド[CCN]+TX、オキサメート[CCN]及びピカリジン[CCN]+TXからなる物質の群から選択される昆虫忌避剤、

1-ジクロロ-1-ニトロエタン(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1058)+TX、1,1-ジクロロ-2,2-ビス(4-エチルフェニル)エタン(IUPAC名)(1056)+TX、1,2-ジクロロプロパン(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1062)+TX、1,2-ジクロロプロパンを伴う1,3-ジクロロプロペン(IUPAC名)(1063)+TX、1-ブromo-2-クロロエタン(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(916)+TX、2,2,2-トリクロロ-1-(3,4-ジクロロフェニル)エチルアセテート(IUPAC名)(1451)+TX、2,2-ジクロロビニル2-エチルスルフィニルエチルメチルホスフェート(IUPAC名)(1066)+TX、2-(1,3-ジチオラン-2-イル)フェニルジメチルカルバメート(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1109)+TX、2-(2-ブトキシエトキシ)エチルチオシアネート(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(935)+TX、2-(4,5-ジメチル-1,3-ジオキソラン-2-イル)フェニルメチルカルバメート(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1084)+TX、2-(4-クロロ-3,5-キシリルオキシ)エタノール(IUPAC名)(986)+TX、2-クロロビニルジエチルホスフェート(IUPAC名)(984)+TX、2-イミダゾリドン(IUPAC名)(1225)+TX、2-イソバレリルインダン-1,3-ジオン(IUPAC名)(1246)+TX、2-メチル(プロパ-2-イニル)アミノフェニルメチルカルバメート(IUPAC名)(1284)+TX、2-チオシアナトエチルラウレート(IUPAC名)(1433)+TX、3-ブromo-1-クロロプロパ-1-エン(IUPAC名)(917)+TX、3-メチル-1-フェニルピラゾール-5-イルジメチルカルバメート(IUPAC名)(1283)+TX、4-メチル(プロパ-2-イニル)アミノ-3,5-キシリルメチルカルバメート(IUPAC名)(1285)+TX、5,5-ジメチル-3-オキソシクロヘキサ-1-エニルジメチルカルバメート(IUPAC名)(1085)+TX、アバメクチン(1)+TX、アセフェート(2)+TX、アセタミプリド(4)+TX、アセチオン(代替名)[CCN]+TX、アセトプロール[CCN]+TX、アクリナトリン(9)+TX、アクリロニトリル(IUPAC名)(861)+TX、アラニカルブ(15)+TX、アルジカルブ(16)+TX、アルドキシカルブ(863)+TX、アルドリン(864)+TX、アレトリン(17)+TX、アロサミジン(代替名)[CCN]+TX、アリキシカルブ(866)+TX、-シペルメトリン(202)+TX、-エクジソン(代替名)[CCN]+TX、リン化アルミニウム(640)+TX、アミジチオン(870)+TX、アミドチオエート(872)+TX、アミノカルブ(873)+TX、アミトン(875)+TX、シュウ酸水素アミトン(875)+TX、アミトラズ(24)+TX、アナバシン(877)+TX、アチダチオン(883)+TX、AVI 382(化合物コード)+TX、AZ 60541(化合物コード)+TX、アザジラクチン(代替名)(41)+TX、アザメチホス(42)+TX、アジンホス-エチル(44)+TX、アジンホス-メチル(45)+TX、アゾトエート(889)+TX、バチルスチューリンゲンシス(*Bacillus thuringiensis*) エンドトキシン(代替名)(52)+TX、ヘキサフル

10

20

30

40

50

オロケイ酸バリウム（代替名）[CCN]+TX、多硫化バリウム（IUPAC/ケミカルアブストラクト名）（892）+TX、バルトリン[CCN]+TX、Bayer 22/190（開発コード）（893）+TX、Bayer 22408（開発コード）（894）+TX、ベンジオカルブ（58）+TX、ベンフラカルブ（60）+TX、ベンスタップ（66）+TX、
 -シフルトリン（194）+TX、
 -シベルメトリン（203）+TX、ピフェントリン（76）+TX、ピオアレトリン（78）+TX、ピオアレトリンS-シクロペンテニル異性体（代替名）（79）+TX、ピオエタノメトリン[CCN]+TX、ピオベルメトリン（908）+TX、ピオレスメトリン（80）+TX、ビス（2-クロロエチル）エーテル（IUPAC名）（909）+TX、ピストリフルロン（83）+TX、ホウ砂（86）+TX、プロフェンバレレート（代替名）+TX
 10
 、プロムフェンピンホス（914）+TX、プロモシクレン（918）+TX、プロモ-DDT（代替名）[CCN]+TX、プロモホス（920）+TX、プロモホス-エチル（921）+TX、プフェンカルブ（924）+TX、ププロフェジン（99）+TX、プタカルブ（926）+TX、プタチオホス（927）+TX、プトカルボキシム（103）+TX、プトネート（932）+TX、プトキシカルボキシム（104）+TX、プチルピリダベン（代替名）+TX、カズサホス（109）+TX、ヒ酸カルシウム[CCN]+TX、シアン化カルシウム（444）+TX、多硫化カルシウム（IUPAC名）（111）+TX、カンフェクロル（941）+TX、カーバノレート（943）+TX、カルバリル（115）+TX、カルボフラン（118）+TX、二硫化炭素（IUPAC/ケミカルアブストラクト名）（945）+TX、四塩化炭素（IUPAC名）（946）+TX、カルボフェノチオン（947）+TX、カルボスルファン（119）+TX
 20
 、カルタップ（123）+TX、カルタップ塩酸塩（123）+TX、セバジン（代替名）（725）+TX、クロルピシクレン（960）+TX、クロルダン（128）+TX、クロルデコン（963）+TX、クロルジメホルム（964）+TX、クロルジメホルム塩酸塩（964）+TX、クロルエトキシホス（129）+TX、クロルフェナピル（130）+TX、クロルフェンピンホス（131）+TX、クロルフルアズロン（132）+TX、クロルメホス（136）+TX、クロロホルム[CCN]+TX、クロロピクリン（141）+TX、クロルホキシム（989）+TX、クロルプラゾホス（990）+TX、クロルピリホス（145）+TX、クロルピリホス-メチル（146）+TX、クロルチオホス（994）+TX、クロマフェノジド（150）+TX、シネリンI（696）+TX、シネリンII（696）+TX、シネリン（696）+TX、シス-レスメトリン（代替名）+TX、シスメトリン（80）+TX、クロシトリン（代替名）+TX、クロエトカルブ（999）+TX、クロサンテル（代替名）[CCN]+TX、クロチアニジン（165）+TX、アセト亜ヒ酸銅[CCN]+TX、ヒ酸銅[CCN]+TX、オレイン酸銅[CCN]+TX、クマホス（174）+TX、クミトエート（1006）+TX、クロタミトン（代替名）[CCN]+TX、クロトキシホス（1010）+TX、クルホメート（1011）+TX、氷晶石（代替名）（177）+TX、CS708（開発コード）（1012）+TX、シアノフェンホス（1019）+TX、シアノホス（184）+TX、シアントエート（1020）+TX、シクレトリン[CCN]+TX、シクロプロトリン（188）+TX、シフルトリン（193）+TX、シハロトリン（196）+TX、シベルメトリン（201）+TX、シフェノトリン（206）+TX、シロマジン（209）+TX、サイチオアート（代替名）[CCN]+TX、d-リモネン（代替名）[CCN]+TX、d-テトラメトリン（代替名）（788）+TX、DAEP（1031）+TX、ダゾメット（216）+TX、DDT（219）+TX、デカルボフラン（1034）+TX、デルタメトリン（223）+TX、デメフィオン（1037）+TX、デメフィオン-O（1037）+TX、デメフィオン-S（1037）+TX、デメトン（1038）+TX、デメトン-メチル（224）+TX、デメトン-O（1038）+TX、デメトン-O-メチル（224）+TX、デメトン-S（1038）+TX、デメトン-S-メチル（224）+TX、デメトン-S-メチルスルホン（1039）+TX、ジアフェンチウロン（226）+TX、ジアリホス（1042）
 30
 40
 50

+ TX、ジアミダホス(1044)+TX、ジアジノン(227)+TX、ジカプトン(1050)+TX、ジクロフェンチオン(1051)+TX、ジクロルボス(236)+TX、ジクリホス(代替名)+TX、ジクレシル(代替名)[CCN]+TX、ジクロトホス(243)+TX、ジシクラニル(244)+TX、ジェルドリン(1070)+TX、ジエチル5-メチルピラゾール-3-イルホスフェート(IUPAC名)(1076)+TX、ジフルベンズロン(250)+TX、ジロール(代替名)[CCN]+TX、ジメフルトリン[CCN]+TX、ジメホックス(1081)+TX、ジメタン(1085)+TX、ジメトエート(262)+TX、ジメトリン(1083)+TX、ジメチルピンホス(265)+TX、ジメチラン(1086)+TX、ジネクス(1089)+TX、ジネクスジクレキシシ(1089)+TX、ジノプロブ(1093)+TX、ジノサム(1094)+TX、ジノセブ(1095)+TX、ジノテフラン(271)+TX、ジオフェノラン(1099)+TX、ジオキサベンゾホス(1100)+TX、ジオキサカルブ(1101)+TX、ジオキサチオン(1102)+TX、ジスルホトン(278)+TX、ジチクロホス(1108)+TX、DNOC(282)+TX、ドラメクチン(代替名)[CCN]+TX、DSP(1115)+TX、エクジステロン(代替名)[CCN]+TX、EI 1642(開発コード)(1118)+TX、エマメクチン(291)+TX、エマメクチン安息香酸塩(291)+TX、EMPC(1120)+TX、エンペントリン(292)+TX、エンドスルファン(294)+TX、エンドチオン(1121)+TX、エンドリン(1122)+TX、EPBP(1123)+TX、EPN(297)+TX、エポフェノナン(1124)+TX、エブリノメクチン(代替名)[CCN]+TX、エスフェンバレレート(302)+TX、エタホス(代替名)[CCN]+TX、エチオフェンカルブ(308)+TX、エチオン(309)+TX、エチプロール(310)+TX、エトエートメチル(1134)+TX、エトプロホス(312)+TX、ギ酸エチル(IUPAC名)[CCN]+TX、エチル-DDD(代替名)(1056)+TX、二臭化エチレン(316)+TX、二塩化エチレン(化学名)(1136)+TX、エチレンオキシド[CCN]+TX、エトフェンプロックス(319)+TX、エトリムホス(1142)+TX、EXD(1143)+TX、ファンファー(323)+TX、フェナミホス(326)+TX、フェナザフロル(1147)+TX、フェンクロルホス(1148)+TX、フェネタカルブ(1149)+TX、フェンフルトリン(1150)+TX、フェニトロチオン(335)+TX、フェノブカルブ(336)+TX、フェノキサクリム(1153)+TX、フェノキシカルブ(340)+TX、フェンピリトリン(1155)+TX、フェンプロパトリン(342)+TX、フェンピラド(代替名)+TX、フェンスルホチオン(1158)+TX、フェンチオン(346)+TX、フェンチオン-エチル[CCN]+TX、フェンバレレート(349)+TX、フィプロニル(354)+TX、フロニカミド(358)+TX、フルベンジアミド(CAS登録番号:272451-65-7)+TX、フルコフロン(1168)+TX、フルシクロクスロン(366)+TX、フルシトリネート(367)+TX、フルエネチル(1169)+TX、フルフェネリム[CCN]+TX、フルフェノクスロン(370)+TX、フルフェンプロックス(1171)+TX、フルメトリン(372)+TX、フルバリネート(1184)+TX、FMC 1137(開発コード)(1185)+TX、ホノホス(1191)+TX、ホルメタネート(405)+TX、ホルメタネート塩酸塩(405)+TX、ホルモチオン(1192)+TX、ホルムパラネート(1193)+TX、ホスメチラン(1194)+TX、ホスピレート(1195)+TX、ホスチアゼート(408)+TX、ホスチエタン(1196)+TX、フラチオカルブ(412)+TX、フレトリン(1200)+TX、-シハロトリン(197)+TX、-HCH(430)+TX、グアザチン(422)+TX、グアザチン酢酸塩(422)+TX、GY-81(開発コード)(423)+TX、ハルフェンプロックス(424)+TX、ハロフェノジド(425)+TX、HCH(430)+TX、HEOD(1070)+TX、ヘプタクロル(1211)+TX、ヘプテノホス(432)+TX、ヘテロホス[CCN]+TX、ヘキサフルムロン(439)+TX、HHDN(864)+TX、

10

20

30

40

50

ヒドラメチルノン(443)+TX、シアン化水素(444)+TX、ハイドロブレン(445)+TX、ヒキンカルブ(1223)+TX、イミダクロプリド(458)+TX、イミプロトリン(460)+TX、インドキサカルブ(465)+TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542)+TX、IPSP(1229)+TX、イサゾホス(1231)+TX、イソベンザン(1232)+TX、イソカルボホス(代替名)(473)+TX、イソドリン(1235)+TX、イソフェンホス(1236)+TX、イソラン(1237)+TX、イソプロカルブ(472)+TX、イソプロピルO-(メトキシアミノチオホスホリル)サリチレート(IUPAC名)(473)+TX、イソプロチオラン(474)+TX、イソチオエート(1244)+TX、イソキサチオン(480)+TX、イベルメクチン(代替名)[CCN]+TX、ジャスモリンI(696)+TX、ジャスモリンII(696)+TX、ヨードフェンホス(1248)+TX、幼若ホルモンI(代替名)[CCN]+TX、幼若ホルモンII(代替名)[CCN]+TX、幼若ホルモンIII(代替名)[CCN]+TX、ケレバン(1249)+TX、キノブレン(484)+TX、シハロトリン(198)+TX、ヒ酸鉛[CCN]+TX、レピメクチン(CCN)+TX、レプトホス(1250)+TX、リンダン(430)+TX、リリムホス(1251)+TX、ルフエヌロン(490)+TX、リチダチオン(1253)+TX、m-クメニルメチルカルバメート(IUPAC名)(1014)+TX、リン化マグネシウム(IUPAC名)(640)+TX、マラチオン(492)+TX、マロノベン(1254)+TX、マジドックス(1255)+TX、メカルバム(502)+TX、メカルフォン(1258)+TX、メナゾン(1260)+TX、メホスホラン(1261)+TX、塩化第一水銀(513)+TX、メスルフェンホス(1263)+TX、メタフルミゾン(CCN)+TX、メタム(519)+TX、メタムカリウム(代替名)(519)+TX、メタムナトリウム(519)+TX、メタクリホス(1266)+TX、メタミドホス(527)+TX、メタンスルホニルフルオリド(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1268)+TX、メチダチオン(529)+TX、メチオカルブ(530)+TX、メトクロトホス(1273)+TX、メトミル(531)+TX、メトブレン(532)+TX、メトキンブチル(1276)+TX、メトトリン(代替名)(533)+TX、メトキシクロル(534)+TX、メトキシフェノジド(535)+TX、臭化メチル(537)+TX、メチルイソチオシアネート(543)+TX、メチルクロロホルム(代替名)[CCN]+TX、塩化メチレン[CCN]+TX、メトフルトリン[CCN]+TX、メトルカルブ(550)+TX、メトキサジアゾン(1288)+TX、メピンホス(556)+TX、メキサカルベート(1290)+TX、ミルベメクチン(557)+TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN]+TX、ミパホックス(1293)+TX、ミレックス(1294)+TX、モノクロトホス(561)+TX、モルホチオン(1300)+TX、モキシデクチン(代替名)[CCN]+TX、ナフタロホス(代替名)[CCN]+TX、ナレド(567)+TX、ナフタレン(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1303)+TX、NC-170(開発コード)(1306)+TX、NC-184(化合物コード)+TX、ニコチン(578)+TX、硫酸ニコチン(578)+TX、ニフルリジド(1309)+TX、ニテンピラム(579)+TX、ニチアジン(1311)+TX、ニトリラカルブ(1313)+TX、ニトリラカルブ1:1塩化亜鉛錯体(1313)+TX、NNI-0101(化合物コード)+TX、NNI-0250(化合物コード)+TX、ノルニコチン(慣習名)(1319)+TX、ノバルロン(585)+TX、ノピフルムロン(586)+TX、O-5-ジクロロ-4-ヨードフェニルO-エチルエチルホスホノチオエート(IUPAC名)(1057)+TX、O,O-ジエチルO-4-メチル-2-オキソ-2H-クロメン-7-イルホスホロチオエート(IUPAC名)(1074)+TX、O,O-ジエチルO-6-メチル-2-プロピルピリミジン-4-イルホスホロチオエート(IUPAC名)(1075)+TX、O,O,O',O'-テトラプロピルジチオピロホスフェート(IUPAC名)(1424)+TX、オレイン酸(IUPAC名)(593)+TX、オメトエート(594)+TX、オキサミル(602)+TX、オキシデメトン-

10

20

30

40

50

メチル(609)+TX、オキシデプロホス(1324)+TX、オキシジスルホトン(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、パラ-ジクロロベンゼン[CCN]+TX、パラチオン(615)+TX、パラチオン-メチル(616)+TX、ペンフルロン(代替名)[CCN]+TX、ペンタクロロフェノール(623)+TX、ラウリン酸ペンタクロロフェニル(IUPAC名)(623)+TX、ベルメトリン(626)+TX、石油(代替名)(628)+TX、PH 60-38(開発コード)(1328)+TX、フェンカプトン(1330)+TX、フェノトリン(630)+TX、フェントエート(631)+TX、ホレート(636)+TX、ホサロン(637)+TX、ホスホラン(1338)+TX、ホスメット(638)+TX、ホスニクロル(1339)+TX、ホスファミドン(639)+TX、ホスフィン(IUPAC名)(640)+TX、ホキシム(642)+TX、ホキシム-メチル(1340)+TX、ピリメタホス(1344)+TX、ピリミカルブ(651)+TX、ピリミホス-エチル(1345)+TX、ピリミホス-メチル(652)+TX、ポリクロロジシクロペンタジエン異性体(IUPAC名)(1346)+TX、ポリクロロテルペン(慣習名)(1347)+TX、亜ヒ酸カリウム[CCN]+TX、チオシアン酸カリウム[CCN]+TX、ブラレトリン(655)+TX、プレコセンI(代替名)[CCN]+TX、プレコセンII(代替名)[CCN]+TX、プレコセンIII(代替名)[CCN]+TX、プリミドホス(1349)+TX、プロフェノホス(662)+TX、プロフルトリン[CCN]+TX、プロマシル(1354)+TX、プロメカルブ(1355)+TX、プロパホス(1356)+TX、プロペタンホス(673)+TX、プロボクサー(678)+TX、プロチダチオン(1360)+TX、プロチオホス(686)+TX、プロトエート(1362)+TX、プロトリフェンビュート[CCN]+TX、ピメトロジン(688)+TX、ピラクロホス(689)+TX、ピラゾホス(693)+TX、ピレスメトリン(1367)+TX、ピレトリンI(696)+TX、ピレトリンII(696)+TX、ピレトリン(696)+TX、ピリダベン(699)+TX、ピリダリル(700)+TX、ピリダフェンチオン(701)+TX、ピリミジフェン(706)+TX、ピリミテート(1370)+TX、ピリプロキシフェン(708)+TX、カッシア(代替名)[CCN]+TX、キナルホス(711)+TX、キナルホス-メチル(1376)+TX、キノチオン(1380)+TX、キンチオキス(1381)+TX、R-1492(開発コード)(1382)+TX、ラホキサニド(代替名)[CCN]+TX、レスメトリン(719)+TX、ロテノン(722)+TX、RU 15525(開発コード)(723)+TX、RU 25475(開発コード)(1386)+TX、リアニア(代替名)(1387)+TX、リアノジン(慣習名)(1387)+TX、サバジラ(代替名)(725)+TX、シュラーダン(1389)+TX、セブホス(代替名)+TX、セラメクチン(代替名)[CCN]+TX、SI-0009(化合物コード)+TX、SI-0205(化合物コード)+TX、SI-0404(化合物コード)+TX、SI-0405(化合物コード)+TX、シラフルオフエン(728)+TX、SN 72129(開発コード)(1397)+TX、亜ヒ酸ナトリウム[CCN]+TX、シアン化ナトリウム(444)+TX、フッ化ナトリウム(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1399)+TX、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム(1400)+TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド(623)+TX、セレン酸ナトリウム(IUPAC名)(1401)+TX、チオシアン酸ナトリウム[CCN]+TX、ソファミド(1402)+TX、スピノサド(737)+TX、スピロメシフェン(739)+TX、スピロテトラマト(CCN)+TX、スルコフロン(746)+TX、スルコフロン-ナトリウム(746)+TX、スルフルアミド(750)+TX、スルホテップ(753)+TX、フッ化スルフリル(756)+TX、スルプロオス(1408)+TX、タール油(代替名)(758)+TX、-フルバリネート(398)+TX、タジムカルブ(1412)+TX、TDE(1414)+TX、テブフェノジド(762)+TX、テブフェンピラド(763)+TX、テブピリムホス(764)+TX、テフルベンズロン(768)+TX、テフルトリン(769)+TX、テメホス(770)+TX、TEPP(1417)+TX

10

20

30

40

50

、テラレトリン(1418)+TX、テルバム(代替名)+TX、テルブホス(773)+TX、テトラクロロエタン[CCN]+TX、テトラクロルピンホス(777)+TX、テトラメトリン(787)+TX、シベルメトリン(204)+TX、チアクロブリド(791)+TX、チアフエノックス(代替名)+TX、チアメトキサム(792)+TX、チクロホス(1428)+TX、チオカルボキシム(1431)+TX、チオシクラム(798)+TX、チオシクラムシュウ酸水素塩(798)+TX、チオジカルブ(799)+TX、チオファノックス(800)+TX、チオメトン(801)+TX、チオナジン(1434)+TX、チオスルタップ(803)+TX、チオスルタップ-ナトリウム(803)+TX、ツリンギエンシン(代替名)[CCN]+TX、トルフェンピラド(809)+TX、トラロメトリン(812)+TX、トランスフルトリン(813)+TX、トランスペルメトリン(1440)+TX、トリアミホス(1441)+TX、トリアザメート(818)+TX、トリアゾホス(820)+TX、トリアズロン(代替名)+TX、トリクロルホン(824)+TX、トリクロルメタホス-3(代替名)[CCN]+TX、トリクロロナート(1452)+TX、トリフェノホス(1455)+TX、トリフルムロン(835)+TX、トリメタカルブ(840)+TX、トリプレン(1459)+TX、バミドチオン(847)+TX、バニリプロール[CCN]+TX、ベラトリジン(代替名)(725)+TX、ベラトリン(代替名)(725)+TX、XMC(853)+TX、キシリルカルブ(854)+TX、YI-5302(化合物コード)+TX、シベルメトリン(205)+TX、メトリン(代替名)+TX、リン化亜鉛(640)+TX、ゾラプロホス(1469)及びZXI 8901(開発コード)(858)+TX、シアントラニリプロール[736994-63-19+TX、クロラントラニリプロール[500008-45-7]+TX、シエノピラフェン[560121-52-0]+TX、シフルメトフェン[400882-07-7]+TX、ピリフルキナゾン[337458-27-2]+TX、スピネトラム[187166-40-1+187166-15-0]+TX、スピロテトラマト[203313-25-1]+TX、スルホキサフロール[946578-00-3]+TX、フルフィプロール[704886-18-0]+TX、メベルフルトリン[915288-13-0]+TX、テトラメチルフルトリン[84937-88-2]+TX、トリフルメゾピリム(国際公開第2012/0922115号に開示されている)+TXからなる物質の群から選択される殺虫剤、

ビス(トリブチルスズ)オキシド(IUPAC名)(913)+TX、プロモアセトアミド[CCN]+TX、ヒ酸カルシウム[CCN]+TX、クロエトカルブ(999)+TX、アセト亜ヒ酸銅[CCN]+TX、硫酸銅(172)+TX、フェンチン(347)+TX、リン酸第二鉄(IUPAC名)(352)+TX、メタアルデヒド(518)+TX、メチオカルブ(530)+TX、ニクロスアミド(576)+TX、ニクロスアミドオラミン(576)+TX、ペンタクロロフェノール(623)+TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド(623)+TX、タジムカルブ(1412)+TX、チオジカルブ(799)+TX、酸化トリブチルスズ(913)+TX、トリフェンモルフ(1454)+TX、トリメタカルブ(840)+TX、酢酸トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)及び水酸化トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)+TX、ピリプロール[394730-71-3]+TXからなる物質の群から選択される殺軟体動物剤、AKD-3088(化合物コード)+TX、1,2-ジプロモ-3-クロロプロパン(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1045)+TX、1,2-ジクロロプロパン(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1062)+TX、1,2-ジクロロプロパンを伴う1,3-ジクロロプロペン(IUPAC名)(1063)+TX、1,3-ジクロロプロペン(233)+TX、3,4-ジクロロテトラヒドロチオフェン1,1-ジオキシド(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1065)+TX、3-(4-クロロフェニル)-5-メチルローダニン(IUPAC名)(980)+TX、5-メチル-6-チオキソ-1,3,5-チアジアジナン-3-イル酢酸(IUPAC名)(1286)+TX、6-イソペンテニルアミノプリン(代替名)(210)+TX、アバメクチ

10

20

30

40

50

ン(1)+TX、アセトプロール[CCN]+TX、アラニカルブ(15)+TX、アルジカルブ(16)+TX、アルドキシカルブ(863)+TX、AZ 60541(化合物コード)+TX、ベンクロチアズ[CCN]+TX、ベノミル(62)+TX、ブチルピリダベン(代替名)+TX、カズサチアゾリジンホス(cadusa thiazolidines fos)(109)+TX、カルボフラン(118)+TX、二硫化炭素(945)+TX、カルボスルファン(119)+TX、クロロピクリン(141)+TX、クロルピリホス(145)+TX、クロエトカルブ(999)+TX、サイトカイニン(代替名)(210)+TX、ダゾメット(216)+TX、DBCP(1045)+TX、DCIP(218)+TX、ジアミダホス(1044)+TX、ジクロフェンチオン(1051)+TX、ジクリホス(代替名)+TX、ジメトエート(262)+TX、
 ドラメクチン(代替名)[CCN]+TX、エマメクチン(291)+TX、エマメクチン安息香酸塩(291)+TX、エプリノメクチン(代替名)[CCN]+TX、エトプロホス(312)+TX、二臭化エチレン(316)+TX、フェナミホス(326)+TX、フェンピラド(代替名)+TX、フェンスルホチオン(1158)+TX、ホスチアゼート(408)+TX、ホスチエタン(1196)+TX、フルフラール(代替名)[CCN]+TX、GY-81(開発コード)(423)+TX、ヘテロホス[CCN]+TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542)+TX、イサミドホス(1230)+TX、イサゾホス(1231)+TX、イベルメクチン(代替名)[CCN]+TX、キネチン(代替名)(210)+TX、メカルフォン(1258)+TX、メタム(519)+TX、メタムカリウム(代替名)(519)+TX、メタムナトリウム(519)+TX、
 臭化メチル(537)+TX、メチルイソチオシアネート(543)+TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN]+TX、モキシデクチン(代替名)[CCN]+TX、クワ暗斑病菌(Myrothecium verrucaria)組成物(代替名)(565)+TX、NC-184(化合物コード)+TX、オキサミル(602)+TX、ホレート(636)+TX、ホスファミドン(639)+TX、ホスホカルブ[CCN]+TX、セブホス(代替名)+TX、セラメクチン(代替名)[CCN]+TX、スピノサド(737)+TX、テルバム(代替名)+TX、テルブホス(773)+TX、テトラクロロチオフェン(IUPAC/ケミカルアブストラクト名)(1422)+TX、チアフェノックス(代替名)+TX、チオナジン(1434)+TX、トリアゾホス(820)+TX、トリアズロン(代替名)+TX、キシレノルス[CCN]+TX、
 YI-5302(化合物コード)及びゼアチン(代替名)(210)+TX、フルエンシルホン[318290-98-1]+TXからなる物質の群から選択される殺線虫剤、エチルキサントゲン酸カリウム[CCN]及びニトラピリン(580)+TXからなる物質の群から選択される硝化抑制剤、
 アシベンゾラル(6)+TX、アシベンゾラル-S-メチル(6)+TX、プロベナゾール(658)及びオオイタドリ(Reynoutria sachalinensis)抽出物(代替名)(720)+TXからなる物質の群から選択される植物活性化剤、
 2-イソバレリルインダン-1,3-ジオン(IUPAC名)(1246)+TX、4-(キノキサリン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド(IUPAC名)(748)+TX、
 -クロロヒドリン[CCN]+TX、リン化アルミニウム(640)+TX、
 アンツ(880)+TX、三酸化ヒ素(882)+TX、炭酸バリウム(891)+TX、
 ビスチオセミ(912)+TX、プロディファコウム(89)+TX、プロマジオロン(91)+TX、プロメタリン(92)+TX、シアン化カルシウム(444)+TX、
 クロラローズ(127)+TX、クロロファシノン(140)+TX、コレカルシフェロール(代替名)(850)+TX、クマクロール(1004)+TX、クマフリル(1005)+TX、クマテトラリル(175)+TX、クリミジン(1009)+TX、ジフェナコウム(246)+TX、ジフェチアロン(249)+TX、ジファシノン(273)+TX、エルゴカルシフェロール(301)+TX、フロクマフェン(357)+TX、フルオロアセトアミド(379)+TX、フルプロバジン(1183)+TX、フルプロバジン塩酸塩(1183)+TX、
 -HCH(430)+TX、HCH(430)+

10

20

30

40

50

TX、シアン化水素(444)+TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542)+TX、リンダン(430)+TX、リン化マグネシウム(IUPAC名)(640)+TX、臭化メチル(537)+TX、ノルボルミド(1318)+TX、ホサセチム(1336)+TX、ホスフィン(IUPAC名)(640)+TX、リン[CCN]+TX、ピンドン(1341)+TX、亜ヒ酸カリウム[CCN]+TX、ピリヌロン(1371)+TX、シリロシド(1390)+TX、亜ヒ酸ナトリウム[CCN]+TX、シアン化ナトリウム(444)+TX、フルオロ酢酸ナトリウム(735)+TX、ストリキニーネ(745)+TX、硫酸タリウム[CCN]+TX、ワルファリン(851)及びリン化亜鉛(640)+TXからなる物質の群から選択される殺鼠剤、

2-(2-ブトキシエトキシ)エチルピペロニレート(IUPAC名)(934)+TX、5-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)-3-ヘキシルシクロヘキサ-2-エノン(IUPAC名)(903)+TX、ファルネソールを伴うネロリドール(代替名)(324)+TX、MB-599(開発コード)(498)+TX、MGK 264(開発コード)(296)+TX、ピペロニルブトキシド(649)+TX、ピプロタル(1343)+TX、プロピル異性体(1358)+TX、S421(開発コード)(724)+TX、セサメックス(1393)+TX、セサモリン(1394)及びスルホキシド(1406)+TXからなる物質の群から選択される共力剤、

アントラキノ(32)+TX、クロラロース(127)+TX、ナフテン酸銅[CCN]+TX、オキシ塩化銅(171)+TX、ジアジノン(227)+TX、ジシクロペンタジエン(化学名)(1069)+TX、グアザチン(422)+TX、グアザチン酢酸塩(422)+TX、メチオカルブ(530)+TX、ピリジン-4-アミン(IUPAC名)(23)+TX、チラム(804)+TX、トリメタカルブ(840)+TX、ナフテン酸亜鉛[CCN]及びジラム(856)+TXからなる物質の群から選択される動物忌避剤、

イマニン(代替名)[CCN]及びリバビリン(代替名)[CCN]+TXからなる物質の群から選択される殺ウイルス剤、

酸化第二水銀(512)+TX、オクチリノン(590)及びチオファネートメチル(802)+TXからなる物質の群から選択される創傷保護剤、

並びにアメトクトラジン[865318-97-4]+TX、アミスルプロム[348635-87-0]+TX、アザコナゾール[60207-31-0]+TX、ベンゾピンジフルピル[1072957-71-1]+TX、ピテルタノール[70585-36-3]+TX、ピキサフェン[581809-46-3]+TX、プロムコナゾール[116255-48-2]+TX、クモキシストロピン[850881-70-8]+TX、シプロコナゾール[94361-06-5]+TX、ジフェノコナゾール[119446-68-3]+TX、ジニコナゾール[83657-24-3]+TX、エノキサストロピン[238410-11-2]+TX、エポキシコナゾール[106325-08-0]+TX、フェンブコナゾール[114369-43-6]+TX、フェンピラザミン[473798-59-3]+TX、フルキンコナゾール[136426-54-5]+TX、フルシラゾール[85509-19-9]+TX、フルトリアホル[76674-21-0]+TX、フルキサピロキサド[907204-31-3]+TX、フルオピラム[658066-35-4]+TX、フェナミンストロピン[366815-39-6]+TX、イソフェタミド[875915-78-9]+TX、ヘキサコナゾール[79983-71-4]+TX、イマザリル[35554-44-0]+TX、イミベンコナゾール[86598-92-7]+TX、イブコナゾール[125225-28-7]+TX、イブフェントリフルコナゾール[1417782-08-1]+TX、イソチアニル[224049-04-1]+TX、マンデストロピン[173662-97-0](国際公開第2010/093059号に記載されている手順に従って調製され得る)+TX、メフェントリフルコナゾール[1417782-03-6]+TX、メトコナゾール[125116-23-6]+TX、ミクロブタニル[88671-89-0]+TX、パクロブトラゾール[76738-62-0]+TX、ペフラゾエート[101903-

10

20

30

40

50

30 - 4] + TX、ペンフルフェン [4 9 4 7 9 3 - 6 7 - 8] + TX、ペンコナゾール
 [6 6 2 4 6 - 8 8 - 6] + TX、プロチオコナゾール [1 7 8 9 2 8 - 7 0 - 6] + T
 X、ピリフェノックス [8 8 2 8 3 - 4 1 - 4] + TX、プロクロラズ [6 7 7 4 7 - 0
 9 - 5] + TX、プロピコナゾール [6 0 2 0 7 - 9 0 - 1] + TX、シメコナゾール [
 1 4 9 5 0 8 - 9 0 - 7] + TX、テブコナゾール [1 0 7 5 3 4 - 9 6 - 3] + TX、
 テトラコナゾール [1 1 2 2 8 1 - 7 7 - 3] + TX、トリアジメホン [4 3 1 2 1 - 4
 3 - 3] + TX、トリアジメノール [5 5 2 1 9 - 6 5 - 3] + TX、トリフルミゾール
 [9 9 3 8 7 - 8 9 - 0] + TX、トリチコナゾール [1 3 1 9 8 3 - 7 2 - 7] + TX
 、アンシミドール [1 2 7 7 1 - 6 8 - 5] + TX、フェナリモル [6 0 1 6 8 - 8 8 -
 9] + TX、ヌアリモル [6 3 2 8 4 - 7 1 - 9] + TX、ブピリメート [4 1 4 8 3 - 10
 4 3 - 6] + TX、ジメチリモール [5 2 2 1 - 5 3 - 4] + TX、エチリモール [2 3
 9 4 7 - 6 0 - 6] + TX、ドデモルフ [1 5 9 3 - 7 7 - 7] + TX、フェンプロピジ
 ン [6 7 3 0 6 - 0 0 - 7] + TX、フェンプロピモルフ [6 7 5 6 4 - 9 1 - 4] + T
 X、スピロキサミン [1 1 8 1 3 4 - 3 0 - 8] + TX、トリデモルフ [8 1 4 1 2 - 4
 3 - 3] + TX、シプロジニル [1 2 1 5 5 2 - 6 1 - 2] + TX、メパニピリム [1 1
 0 2 3 5 - 4 7 - 7] + TX、ピリメタニル [5 3 1 1 2 - 2 8 - 0] + TX、フェンピ
 クロニル [7 4 7 3 8 - 1 7 - 3] + TX、フルジオキシソニル [1 3 1 3 4 1 - 8 6 - 1
] + TX、フルインダピル [1 3 8 3 8 0 9 - 8 7 - 7] + TX、ベナラキシル [7 1 6
 2 6 - 1 1 - 4] + TX、フララキシル [5 7 6 4 6 - 3 0 - 7] + TX、メタラキシル
 [5 7 8 3 7 - 1 9 - 1] + TX、R - メタラキシル [7 0 6 3 0 - 1 7 - 0] + TX、 20
 オフレース [5 8 8 1 0 - 4 8 - 3] + TX、オキサジキシル [7 7 7 3 2 - 0 9 - 3]
 + TX、ベノミル [1 7 8 0 4 - 3 5 - 2] + TX、カルベンダジム [1 0 6 0 5 - 2 1
 - 7] + TX、デバカルブ [6 2 7 3 2 - 9 1 - 6] + TX、フベリダゾール [3 8 7 8
 - 1 9 - 1] + TX、チアベンダゾール [1 4 8 - 7 9 - 8] + TX、クロゾリネート [
 8 4 3 3 2 - 8 6 - 5] + TX、ジクロゾリン [2 4 2 0 1 - 5 8 - 9] + TX、イプロ
 ジオン [3 6 7 3 4 - 1 9 - 7] + TX、ミクロゾリン [5 4 8 6 4 - 6 1 - 8] + TX
 、プロシミドン [3 2 8 0 9 - 1 6 - 8] + TX、ピンクロゾリン [5 0 4 7 1 - 4 4 -
 8] + TX、ボスカリド [1 8 8 4 2 5 - 8 5 - 6] + TX、カルボキシシン [5 2 3 4 -
 6 8 - 4] + TX、フェンフラム [2 4 6 9 1 - 8 0 - 3] + TX、フルトラニル [6 6
 3 3 2 - 9 6 - 5] + TX、フルチアニル [9 5 8 6 4 7 - 1 0 - 4] + TX、メプロニ
 ル [5 5 8 1 4 - 4 1 - 0] + TX、オキシカルボキシシン [5 2 5 9 - 8 8 - 1] + TX 30
 、ペンチオピラド [1 8 3 6 7 5 - 8 2 - 3] + TX、チフルザミド [1 3 0 0 0 0 - 4
 0 - 7] + TX、グアザチン [1 0 8 1 7 3 - 9 0 - 6] + TX、ドジン [2 4 3 9 - 1
 0 - 3] [1 1 2 - 6 5 - 2] (遊離塩基) + TX、イミノクタジン [1 3 5 1 6 - 2 7
 - 3] + TX、アゾキシストロピン [1 3 1 8 6 0 - 3 3 - 8] + TX、ジモキシストロ
 ピン [1 4 9 9 6 1 - 5 2 - 4] + TX、エネステロブリン { Proc . B C P C , In
 t . Congr . , G l a s g o w , 2 0 0 3 , 1 , 9 3 } + TX、フルオキサストロピ
 ン [3 6 1 3 7 7 - 2 9 - 9] + TX、クレソキシムメチル [1 4 3 3 9 0 - 8 9 - 0]
 + TX、メトミノストロピン [1 3 3 4 0 8 - 5 0 - 1] + TX、トリフロキシストロピ
 ン [1 4 1 5 1 7 - 2 1 - 7] + TX、オリザストロピン [2 4 8 5 9 3 - 1 6 - 0] + 40
 TX、ピコキシストロピン [1 1 7 4 2 8 - 2 2 - 5] + TX、ピラクロストロピン [1
 7 5 0 1 3 - 1 8 - 0] + TX、ピラオキシストロピン [8 6 2 5 8 8 - 1 1 - 2] + T
 X、フェルバム [1 4 4 8 4 - 6 4 - 1] + TX、マンコゼブ [8 0 1 8 - 0 1 - 7] +
 TX、マネブ [1 2 4 2 7 - 3 8 - 2] + TX、メチラム [9 0 0 6 - 4 2 - 2] + TX
 、プロピネブ [1 2 0 7 1 - 8 3 - 9] + TX、チラム [1 3 7 - 2 6 - 8] + TX、ジ
 ネブ [1 2 1 2 2 - 6 7 - 7] + TX、ジラム [1 3 7 - 3 0 - 4] + TX、カプタホー
 ル [2 4 2 5 - 0 6 - 1] + TX、カプタン [1 3 3 - 0 6 - 2] + TX、ジクロフルア
 ニド [1 0 8 5 - 9 8 - 9] + TX、フルオロイミド [4 1 2 0 5 - 2 1 - 4] + TX、
 ホルベット [1 3 3 - 0 7 - 3] + TX、トリルフルアニド [7 3 1 - 2 7 - 1] + TX
 、ボルドー液 [8 0 1 1 - 6 3 - 0] + TX、水酸化銅 [2 0 4 2 7 - 5 9 - 2] + TX 50

、オキシ塩化銅 [1 3 3 2 - 4 0 - 7] + T X、硫酸銅 [7 7 5 8 - 9 8 - 7] + T X、
 酸化銅 [1 3 1 7 - 3 9 - 1] + T X、マンカップ [5 3 9 8 8 - 9 3 - 5] + T X、
 オキシ銅 [1 0 3 8 0 - 2 8 - 6] + T X、ジノカップ [1 3 1 - 7 2 - 6] + T X、
 ニトロタールイソプロピル [1 0 5 5 2 - 7 4 - 6] + T X、エジフェンホス [1 7 1 0
 9 - 4 9 - 8] + T X、イプロベンホス [2 6 0 8 7 - 4 7 - 8] + T X、イソプロチオ
 ラン [5 0 5 1 2 - 3 5 - 1] + T X、ホスジフェン [3 6 5 1 9 - 0 0 - 3] + T X、
 ピラゾホス [1 3 4 5 7 - 1 8 - 6] + T X、トルクロホス - メチル [5 7 0 1 8 - 0 4
 - 9] + T X、アシベンゾラル - S - メチル [1 3 5 1 5 8 - 5 4 - 2] + T X、アニラ
 ジン [1 0 1 - 0 5 - 3] + T X、ベンチアパリカルブ [4 1 3 6 1 5 - 3 5 - 7] + T
 X、ブラストサイジン - S [2 0 7 9 - 0 0 - 7] + T X、キノメチオナト [2 4 3 9 -
 0 1 - 2] + T X、クロロネブ [2 6 7 5 - 7 7 - 6] + T X、クロロタロニル [1 8 9
 7 - 4 5 - 6] + T X、シフルフェナミド [1 8 0 4 0 9 - 6 0 - 3] + T X、シモキサ
 ニル [5 7 9 6 6 - 9 5 - 7] + T X、ジクロン [1 1 7 - 8 0 - 6] + T X、ジクロシ
 メット [1 3 9 9 2 0 - 3 2 - 4] + T X、ジクロメジン [6 2 8 6 5 - 3 6 - 5] + T
 X、ジクロラン [9 9 - 3 0 - 9] + T X、ジエトフェンカルブ [8 7 1 3 0 - 2 0 - 9
] + T X、ジメトモルフ [1 1 0 4 8 8 - 7 0 - 5] + T X、S Y P - L I 9 0 (フルモ
 ルフ) [2 1 1 8 6 7 - 4 7 - 9] + T X、ジチアノン [3 3 4 7 - 2 2 - 6] + T X、
 エタボキサム [1 6 2 6 5 0 - 7 7 - 3] + T X、エトリジアゾール [2 5 9 3 - 1 5 -
 9] + T X、ファモキサドン [1 3 1 8 0 7 - 5 7 - 3] + T X、フェナミドン [1 6 1
 3 2 6 - 3 4 - 7] + T X、フェノキサニル [1 1 5 8 5 2 - 4 8 - 7] + T X、フェン
 チン [6 6 8 - 3 4 - 8] + T X、フェリムゾン [8 9 2 6 9 - 6 4 - 7] + T X、フル
 アジナム [7 9 6 2 2 - 5 9 - 6] + T X、フルオピコリド [2 3 9 1 1 0 - 1 5 - 7]
 + T X、フルスルファミド [1 0 6 9 1 7 - 5 2 - 6] + T X、フェンヘキサミド [1 2
 6 8 3 3 - 1 7 - 8] + T X、ホセチルアルミニウム [3 9 1 4 8 - 2 4 - 8] + T X、
 ヒメキサゾール [1 0 0 0 4 - 4 4 - 1] + T X、イプロバリカルブ [1 4 0 9 2 3 - 1
 7 - 7] + T X、I K F - 9 1 6 (シアゾファミド) [1 2 0 1 1 6 - 8 8 - 3] + T X
 、カスガマイシン [6 9 8 0 - 1 8 - 3] + T X、メタスルホカルブ [6 6 9 5 2 - 4 9
 - 6] + T X、メトラフェノン [2 2 0 8 9 9 - 0 3 - 6] + T X、ペンシクロン [6 6
 0 6 3 - 0 5 - 6] + T X、フタリド [2 7 3 5 5 - 2 2 - 2] + T X、ピカルブトラゾ
 クス [5 0 0 2 0 7 - 0 4 - 5] + T X、ポリオキシシン [1 1 1 1 3 - 8 0 - 7] + T X
 、プロベナゾール [2 7 6 0 5 - 7 6 - 1] + T X、プロパモカルブ [2 5 6 0 6 - 4 1
 - 1] + T X、プロキナジド [1 8 9 2 7 8 - 1 2 - 4] + T X、ピジフルメトフェン [
 1 2 2 8 2 8 4 - 6 4 - 7] + T X、ピラメトストロピン [9 1 5 4 1 0 - 7 0 - 7] +
 T X、ピロキロン [5 7 3 6 9 - 3 2 - 1] + T X、ピリオフェノン [6 8 8 0 4 6 - 6
 1 - 9] + T X、ピリベンカルブ [7 9 9 2 4 7 - 5 2 - 2] + T X、ピリソキサゾール
 [8 4 7 7 4 9 - 3 7 - 5] + T X、キノキシフェン [1 2 4 4 9 5 - 1 8 - 7] + T X
 、キントゼン [8 2 - 6 8 - 8] + T X、硫黄 [7 7 0 4 - 3 4 - 9] + T X、T i m o
 r e x G o l d (商 標) (S t o c k t o n G r o u p 製のティーツリー油を含有する
 植物抽出物) + T X、テブフロキン [3 7 6 6 4 5 - 7 8 - 2] + T X、チアジニル [2
 2 3 5 8 0 - 5 1 - 6] + T X、トリアゾキシド [7 2 4 5 9 - 5 8 - 6] + T X、トル
 プロカルブ [9 1 1 4 9 9 - 6 2 - 2] + T X、トリクロピリカルブ [9 0 2 7 6 0 - 4
 0 - 1] + T X、トリシクラゾール [4 1 8 1 4 - 7 8 - 2] + T X、トリホリン [2 6
 6 4 4 - 4 6 - 2] + T X、バリダマイシン [3 7 2 4 8 - 4 7 - 8] + T X、バリフェ
 ナレート [2 8 3 1 5 9 - 9 0 - 0] + T X、ゾキサミド (R H 7 2 8 1) [1 5 6 0 5
 2 - 6 8 - 5] + T X、マンジプロパミド [3 7 4 7 2 6 - 6 2 - 2] + T X、イソピラ
 ザム [8 8 1 6 8 5 - 5 8 - 1] + T X、フェナマクリル + T X、セダキサン [8 7 4 9
 6 7 - 6 7 - 6] + T X、トリネキサパックエチル [9 5 2 6 6 - 4 0 - 3] + T X、3
 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (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) - ア
 ミド (国際公開第 2 0 0 7 / 0 4 8 5 5 6 号に開示されている) + T X、3 - ジフルオロ

10

20

30

40

50

メチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (3 ' , 4 ' , 5 ' - トリフルオロ - ビフェニル - 2 - イル) - アミド (国際公開第 2 0 0 6 / 0 8 7 3 4 3 号に開示されている) + T X、 [(3 S , 4 R , 4 a R , 6 S , 6 a S , 1 2 R , 1 2 a S , 1 2 b S) - 3 - [(シクロプロピルカルボニル) オキシ] - 1 , 3 , 4 , 4 a , 5 , 6 , 6 a , 1 2 , 1 2 a , 1 2 b - デカヒドロ - 6 , 1 2 - ジヒドロキシ - 4 , 6 a , 1 2 b - トリメチル - 1 1 - オキソ - 9 - (3 - ピリジニル) - 2 H , 1 1 H ナフト [2 , 1 - b] ピラノ [3 , 4 - e] ピラン - 4 - イル] メチル - シクロプロパンカルボキシレート [9 1 5 9 7 2 - 1 7 - 7] + T X 及び 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - (2 - メチル - 1 - オキソプロピル) - N - [3 - (2 - メチルプロピル) - 4 - [2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - メトキシ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル] フェニル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド [9 2 6 9 1 4 - 5 5 - 8] + T X からなる群から選択される生物学的に活性な化合物、

10

又は N - [(5 - クロロ - 2 - イソプロピル - フェニル) メチル] - 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 - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (国際公開第 2 0 1 0 / 1 3 0 7 6 7 号に記載されている手順に従って調製され得る) + T X、 2 , 6 - ジメチル - 1 H , 5 H - [1 , 4] ジチイノ [2 , 3 - c : 5 , 6 - c '] ジピロール - 1 , 3 , 5 , 7 (2 H , 6 H) - テトロン (国際公開第 2 0 1 1 / 1 3 8 2 8 1 号に記載されている手順に従って調製され得る) + T X、 6 - エチル - 5 , 7 - ジオキソ - ピロロ [4 , 5] [1 , 4] ジチイノ [1 , 2 - c] イソチアゾール - 3 - カルボニトリル + T X、 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) - 2 , 5 - ジメチル - ピラゾール - 3 - アミン (国際公開第 2 0 1 2 / 0 3 1 0 6 1 号に記載されている手順に従って調製され得る) + T X、 3 - (ジフルオロメチル) - N - (7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - インダン - 4 - イル) - 1 - メチル - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (国際公開第 2 0 1 2 / 0 8 4 8 1 2 号に記載されている手順に従って調製され得る) + T X、 C A S 8 5 0 8 8 1 - 3 0 - 0 + T X、 3 - (3 , 4 - ジクロロ - 1 , 2 - チアゾール - 5 - イルメトキシ) - 1 , 2 - ベンゾチアゾール 1 , 1 - ジオキシド (国際公開第 2 0 0 7 / 1 2 9 4 5 4 号に記載されている手順に従って調製され得る) + T X、 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 + T X、 3 - (4 , 4 - ジフルオロ - 3 , 4 - ジヒドロ - 3 , 3 - ジメチルイソキノリン - 1 - イル) キノロン (国際公開第 2 0 0 5 / 0 7 0 9 1 7 号に記載されている手順に従って調製され得る) + T X、 2 - [2 - フルオロ - 6 - [(8 - フルオロ - 2 - メチル - 3 - キノリル) オキシ] フェニル] プロパン - 2 - オール (国際公開第 2 0 1 1 / 0 8 1 1 7 4 号に記載されている手順に従って調製され得る) + T X、 2 - [2 - [(7 , 8 - ジフルオロ - 2 - メチル - 3 - キノリル) オキシ] - 6 - フルオロ - フェニル] プロパン - 2 - オール (国際公開第 2 0 1 1 / 0 8 1 1 7 4 号に記載されている手順に従って調製され得る) + T X、 オキサチアピプロリン + T X [1 0 0 3 3 1 8 - 6 7 - 9]、 tert - ブチル N - [6 - [[(1 - メチルテトラゾール - 5 - イル) - フェニル - メチレン] アミノ] オキシメチル] - 2 - ピリジル] カルバメート + T X、 N - [2 - (3 , 4 - ジフルオロフェニル) フェニル] - 3 - (トリフルオロメチル) ピラジン - 2 - カルボキサミド (国際公開第 2 0 0 7 / 0 7 2 9 9 9 号に記載されている手順に従って調製され得る) + T X、 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル] ピラゾール - 4 - カルボキサミド (国際公開第 2 0 1 4 / 0 1 3 8 4 2 号に記載されている手順に従って調製され得る) + T X、 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル N - [2 - メチル - 1 - [[(4 - メチルベンゾイル) アミノ] メチル] プロピル] カルバメート + T X、 (2 R S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - , , - トリフルオロ - o - トリル] - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール + T X、 (2 R S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - , , - トリフルオロ - o - トリル] - 3 - メチル - 1 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール + T X、 2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 R) - 3 -

20

30

40

50

エチル - 1 , 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + T X
 、 2 - (ジフルオロメチル) - N - [3 - エチル - 1 , 1 - ジメチル - インダン - 4 - イ
 ル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + T X 、 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 - ホルムアミジン + T X 、 N ' - [4 - (4 , 5 - ジ
 クロロチアゾール - 2 - イル) オキシ - 2 , 5 - ジメチル - フェニル] - N - エチル - N
 - メチル - ホルムアミジン (国際公開第 2 0 0 7 / 0 3 1 5 1 3 号に記載されている手順
 に従って調製され得る) + T X 、 [2 - [3 - [2 - [1 - [2 - [3 , 5 - ビス (ジフル
 オロメチル) ピラゾール - 1 - イル] アセチル] - 4 - ピペリジル] チアゾール - 4 -
 イル] - 4 , 5 - ジヒドロイソオキサゾール - 5 - イル] - 3 - クロロ - フェニル] メタ
 ンスルホネート (国際公開第 2 0 1 2 / 0 2 5 5 5 7 号に記載されている手順に従って調
 製され得る) + T X 、 ブタ - 3 - イニル N - [6 - [[(Z) - [(1 - メチルテトラゾ
 ール - 5 - イル) - フェニル - メチレン] アミノ] オキシメチル] - 2 - ピリジル] カル
 バメート (国際公開第 2 0 1 0 / 0 0 0 8 4 1 号に記載されている手順に従って調製され
 得る) + T X 、 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] - 4 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン (国
 際公開第 2 0 1 0 / 1 4 6 0 3 1 号に記載されている手順に従って調製され得る) + T
 X 、 メチル N - [[5 - [4 - (2 , 4 - ジメチルフェニル) トリアゾール - 2 - イル]
 - 2 - メチル - フェニル] メチル] カルバメート + T X 、 3 - クロロ - 6 - メチル - 5 -
 フェニル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリフルオロフェニル) ピリダジン (国際公開第 2 0 0 5
 / 1 2 1 1 0 4 号に記載されている手順に従って調製され得る) + T X 、 2 - [2 - クロ
 ロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ) フェニル] - 1 - (1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 -
 イル) プロパン - 2 - オール (国際公開第 2 0 1 3 / 0 2 4 0 8 2 号に記載されている手
 順に従って調製され得る) + T X 、 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 (国際公開第 2 0 1 2 / 0 2 0 7 7 4 号に記載さ
 れている手順に従って調製され得る) + T X 、 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 - 3 - カルボニトリル (国際公開第 2 0 1 2 / 0 2
 0 7 7 4 号に記載されている手順に従って調製され得る) + T X 、 (R) - 3 - (ジフル
 オロメチル) - 1 - メチル - N - [1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル] ピラゾ
 ール - 4 - カルボキサミド (国際公開第 2 0 1 1 / 1 6 2 3 9 7 号に記載されている手順
 に従って調製され得る) + T X 、 3 - (ジフルオロメチル) - N - (7 - フルオロ - 1 ,
 1 , 3 - トリメチル - インダン - 4 - イル) - 1 - メチル - ピラゾール - 4 - カルボキサ
 ミド (国際公開第 2 0 1 2 / 0 8 4 8 1 2 号に記載されている手順に従って調製され得る
) + T X 、 1 - [2 - [[1 - (4 - クロロフェニル) ピラゾール - 3 - イル] オキシメ
 チル] - 3 - メチル - フェニル] - 4 - メチル - テトラゾール - 5 - オン (国際公開第 2
 0 1 3 / 1 6 2 0 7 2 号に記載されている手順に従って調製され得る) + T X 、 1 - メチ
 ル - 4 - [3 - メチル - 2 - [[2 - メチル - 4 - (3 , 4 , 5 - トリメチルピラゾール
 - 1 - イル) フェノキシ] メチル] フェニル] テトラゾール - 5 - オン (国際公開第 2 0
 1 4 / 0 5 1 1 6 5 号に記載されている手順に従って調製され得る) + T X 、 (Z , 2 E)
 - 5 - [1 - (4 - クロロフェニル) 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 + T X 、 (4 - フェノキシフェニル)
 メチル 2 - アミノ - 6 - メチル - ピリジン - 3 - カルボキシレート + T X 、 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 - メチルピラゾール - 4 - カルボキサミド [1 2 5 5 7 3 4 - 2 8 - 1
] (国際公開第 2 0 1 0 / 1 3 0 7 6 7 号に記載されている手順に従って調製され得る)
 + T X 、 3 - (ジフルオロメチル) - N - [(R) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 1 , 3 - ト
 リメチル - 1 H - インデン - 4 - イル] - 1 - メチルピラゾール - 4 - カルボキサミド [1
 3 5 2 9 9 4 - 6 7 - 2] + T X 、 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 - ホルムアミジン + T X 、 N ' - [4 - (4 , 5 - ジクロ
 ロ - 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 - ホルムアミジン + T X 、 N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - フェノキシ - フェニル) -

10

20

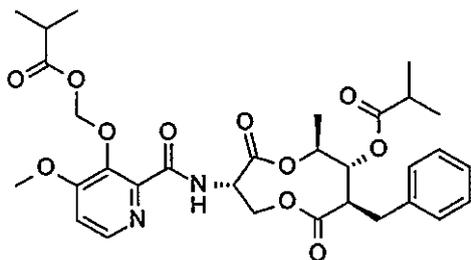
30

40

50

N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N' - [4 - (4 , 5 - ジクロロ - 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 - ホルムアミジン + TX、

【化15】



10

(フェンピコキサミド [5 1 7 8 7 5 - 3 4 - 2] (国際公開第 2 0 0 3 / 0 3 5 6 1 7 号に記載されている)) + TX、(1 S) - 2 , 2 - ビス (4 - フルオロフェニル) - 1 - メチルエチル N - { [3 - (アセチルオキシ) - 4 - メトキシ - 2 - ピリジル] カルボニル } - L - アラニナト [1 9 6 1 3 1 2 - 5 5 - 9] (国際公開第 2 0 1 6 / 1 2 2 8 0 2 号に記載されている) + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - (1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - (3 - エチル - 1 , 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - (1 , 1 - ジメチル - 3 - プロピル - インダン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - (3 - イソブチル - 1 , 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 R) - 3 - エチル - 1 , 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、及び 2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 R) - 1 , 1 - ジメチル - 3 - プロピル - インダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX (ここで、これらのカルボキサミド化合物は各々、国際公開第 2 0 1 4 / 0 9 5 6 7 5 号及び/又は国際公開第 2 0 1 6 / 1 3 9 1 8 9 号に記載されている手順に従って調製され得る) からなる群から選択される生物学的に活性な化合物。

20

30

【0194】

例えば [3 8 7 8 - 1 9 - 1] といった有効成分に続く括弧中の参照は、ケミカルアブストラクツ登録番号を指す。上記の混合相手は公知である。有効成分が “ The Pesticide Manual ” [The Pesticide Manual - A World Compendium ; Thirteenth Edition ; Editor : C . D . S . Tomlin ; The British Crop Protection Council] 中に含まれている場合、これらは、特定の化合物について本明細書中上記の丸括弧中に示されている項目番号下でその中に記載されており；例えば、化合物「アバメクチン」は、項目番号 (1) 下に記載されている。上記に記載の特定の化合物について「 [CCN] 」が付記されている場合、対象の化合物は [A . Wood ; Compendium of Pesticide Common Names , Copyright (著作権) 1 9 9 5 - 2 0 0 4] にてインターネットを介してアクセス可能である “ Compendium of Pesticide Common Names ” に含まれており；例えば、化合物「アセトプロール」は、インターネットアドレス <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html> において記載されている。

40

【0195】

上記の有効成分の大部分は、いわゆる「慣用名」、関連する「ISO慣用名」又は別の「慣用名」を個々の事例において用いることにより言及されている。「慣用名」による呼

50

称ではない場合、代わりに用いられる呼称の性質は特定の化合物について丸括弧中に記載されており；この場合、IUPAC名、IUPAC/ケミカルアブストラクツ名、「化学名」、「慣習名」、「化合物名」若しくは又は「開発コード」が用いられており、又は、これらの呼称若しくは「慣用名」のいずれも用いられていない場合には、「代替名」が用いられている。「CAS登録番号」とは、ケミカルアブストラクツ登録番号を意味する。

【0196】

表A1～A8（上記）又は表E（下記）に示される1つの化合物から選択される式（I）の化合物の有効成分混合物は、好ましくは、100：1～1：6000、特に、50：1～1：50の混合比で、より特に、20：1～1：20、さらにより特に、10：1～1：10、非常に特に、5：1及び1：5の比であり、2：1～1：2の比が特に好ましく、4：1～2：1の比が同様に好ましく、とりわけ、1：1、又は5：1、又は5：2、又は5：3、又は5：4、又は4：1、又は4：2、又は4：3、又は3：1、又は3：2、又は2：1、又は1：5、又は2：5、又は3：5、又は4：5、又は1：4、又は2：4、又は3：4、又は1：3、又は2：3、又は1：2、又は1：600、又は1：300、又は1：150、又は1：35、又は2：35、又は4：35、又は1：75、又は2：75、又は4：75、又は1：6000、又は1：3000、又は1：1500、又は1：350、又は2：350、又は4：350、又は1：750、又は2：750、又は4：750の比が好ましい。これらの混合比は、重量比である。

10

【0197】

上記の混合物は、上記の混合物を含む組成物を有害生物若しくはその環境に適用することを含む、有害生物を防除するための方法において用いられることが可能であるが、手術又は治療によるヒト若しくは動物の身体の処置法及びヒト若しくは動物の身体において実施される診断法は除かれる。

20

【0198】

表A1～A8（上記）又は表E（下記）に示される化合物と、上記の1種以上の有効成分とを含む混合物は、例えば、単一の「調合済み」形態で、単一の有効成分構成要素の個々の配合物から構成される「タンク混合物」などの複合型噴霧混合物で、及び逐次的（すなわち、数時間又は数日間などの適度に短時間のうちに次々と）に適用される場合には単一の有効成分を併用して適用されることが可能である。表A1～A8（上記）又は表E（下記）に示される化合物及び上記の有効成分を適用する順序は、本発明を行うのに重要ではない。

30

【0199】

本発明に係る組成物はまた、安定剤、例えば非エポキシ化又はエポキシ化植物油（例えばエポキシ化ヤシ油、ナタネ油又は大豆油）、消泡剤、例えばシリコーン油、防腐剤、粘性調節剤、バインダ及び/又は粘着付与剤、肥料又は特定の効果を達成するための他の有効成分、例えば殺菌剤、殺菌・殺カビ剤、殺線虫剤、植物活性化剤、殺軟体動物剤又は除草剤などのさらなる固体助剤若しくは液体助剤を含んでいることが可能である。

【0200】

本発明に係る組成物は、それ自体公知である方法で、助剤の非存在下で、例えば、固体有効成分を粉末化し、篩にかけ、及び/又は圧縮することにより調製され、及び少なくとも1種の助剤の存在下で、例えば、有効成分を助剤と共に均質混合し、及び/又は粉末化することにより調製される。組成物のこれらの調製プロセス及びこれらの組成物を調製するための化合物（I）の使用もまた本発明の主題である。

40

【0201】

本発明の別の態様は、式（I）の化合物若しくは本明細書に定義されている好ましい個別の化合物、式（I）の少なくとも1つの化合物若しくは上記に定義されている少なくとも1つの好ましい個別の化合物を含む組成物、又は上記の他の殺菌・殺カビ剤若しくは殺虫剤と混合された、式（I）の少なくとも1つの化合物若しくは上記に定義されている少なくとも1つの好ましい個別の化合物を含む殺菌・殺カビ若しくは殺虫性混合物の使用であって、作物植物、例えば種子といったその繁殖材料、例えば収穫された食品作物といっ

50

た収穫された作物などの例えば有用な植物といった植物、又は昆虫若しくは好ましくは真菌性生物といった植物病原性微生物による非生体材料に係る外寄生を防除若しくは予防するための使用に関する。

【0202】

本発明のさらなる態様は、作物植物、例えば種子といったその繁殖体、例えば収穫された食品作物といった収穫された作物などの例えば有用な植物といった植物、又は、特に真菌性生物といった植物病原性若しくはヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物若しくは生物による非生体材料に係る外寄生を防除若しくは予防する方法に関し、この方法は、式(I)の化合物若しくは上記に定義されている好ましい個別の化合物を、有効成分として植物、植物の一部若しくはその生息地、その繁殖体、又は、非生体材料のいずれかの部分に適用するステップを含む。

10

【0203】

防除若しくは予防とは、昆虫による、又は、特に真菌性生物といった植物病原性若しくはヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物若しくは生物による外寄生を、向上が実証されるレベルまで低減させることを意味する。

【0204】

特に真菌性生物といった植物病原性微生物又は昆虫による作物植物の外寄生を防除若しくは予防する好ましい方法であって、式(I)の化合物又は前記化合物の少なくとも1種を含有する農芸化学組成物の適用を含む方法は、葉面処理である。適用頻度及び適用量は、対応する病原体又は昆虫による外寄生のリスクに応じることとなる。しかしながら、式(I)の化合物はまた、植物の生息地に液体配合物を灌注することにより、又は、例えば粒状形態(土壌施用)の固体形態で化合物を土壌に適用することにより、土壌(浸透移行作用)を介して根から植物に浸透させることが可能である。水稻作物の場合、このような粒質物を湛水した水田に適用することが可能である。式(I)の化合物はまた、種子又は塊茎を殺菌・殺カビ剤の液体配合物に含浸させることにより、又は、これらを固体配合物でコーティングすることにより、種子に適用(コーティング)され得る。

20

【0205】

例えば、式(I)の化合物と、所望の場合に、式(I)の化合物をカプセル化する固体又は液体補助剤又はモノマーとを含有する組成物といった配合物は、公知の様式で、典型的には、化合物を例えば溶剤、固体キャリア及び任意選択により表面活性化合物(界面活性剤)といった増量剤と一緒に均質に混合し、及び/又は、粉碎することにより調製され得る。

30

【0206】

流行している状況における意図される目的、及び、上述の種類の有害生物を防除するための組成物の使用に適合するよう選択されるべきである、吹付け、噴霧、散粉、はけ塗り、粉衣、拡散又は流しかけなどの上述の種類の有害生物の防除方法である組成物の適用方法が本発明の他の主題である。典型的な濃度割合は、0.1~1000ppm、好ましくは0.1~500ppmの有効成分である。1ヘクタール当たりの適用量は、好ましくは1g~2000gの有効成分/ヘクタール、より好ましくは10~1000g/ha、最も好ましくは10~600g/haである。種子灌注剤として用いられる場合、簡便な投与量は、1kgの種子に対して10mg~1gの活性物質である。

40

【0207】

本発明の組み合わせが種子の処理に用いられる場合、1kgの種子に対して0.001~50gの式(I)の化合物、好ましくは、1kgの種子に対して0.01~10gの量が一般に十分とされる。

【0208】

好適には、本発明に係る式(I)の化合物を含む組成物は、病害の発生前を意味する予防的に、又は、病害の発生後を意味する治療的に適用される。

【0209】

本発明の組成物は、いずれかの従来形態、例えば、二液系、乾燥種子処理用粉末(D

50

S)、種子処理用エマルジョン(E S)、種子処理用流動性濃縮物(F S)、種子処理用溶液(L S)、種子処理用水分散性粉末(W S)、種子処理用カプセル懸濁液(C F)、種子処理用ゲル(G F)、エマルジョン濃縮物(E C)、懸濁液濃縮物(S C)、サスポエマルジョン(S E)、カプセル懸濁液(C S)、水分散性顆粒(W G)、乳化性顆粒(E G)、エマルジョン、油中水型(E O)、エマルジョン、水中油型(E W)、マイクロエマルジョン(M E)、油分散体(O D)、油混和性の流動体(O F)、混油性液体(O L)、可溶性濃縮物(S L)、超低体積懸濁液(S U)、超低体積液体(U L)、工業用濃縮物(T K)、分散性濃縮物(D C)、水和剤(W P)、又は、農学的に許容可能な補助剤と組み合わせられるいずれかの技術的に好ましい配合物の形態で採用され得る。

【0210】

このような組成物は、従来の様式で、例えば有効成分を、適切な不活性配合物(希釈剤、溶剤、充填材、並びに、界面活性剤、殺生剤、不凍剤、展着剤、増粘剤及びアジュバント活性効果をもたらす化合物などの任意により他の配合成分)と混合することにより、生成され得る。また、従来の緩効性配合物は、長期にわたって持続する効力が意図される場合に採用され得る。特に、水分散性濃縮物(例えばE C、S C、D C、O D、S E、E W、E O等)、水和剤及び顆粒などの吹付け形態で適用される配合物は、例えばホルムアルデヒドとナフタレンスルホン酸塩との縮合物、アルキルアリアルスルホネート、リグニンスルホン酸塩、脂肪アルキルスルフェート、及びエトキシ化アルキルフェノール及びエトキシ化脂肪族アルコールといった、湿潤剤及び分散剤及びアジュバント効果をもたらす他の化合物などの界面活性剤を含有していてもよい。

【0211】

種子粉衣配合物は種子にそれ自体公知である様式で適用され、例えば水性懸濁液又は種子に良好な接着性を有する乾燥粉末形態といった好適な種子粉衣配合物形態で、本発明の組み合わせ及び希釈剤を利用する。このような種子粉衣配合物は技術分野において公知である。種子粉衣配合物は、単一種の有効成分を含有していても、又は、例えば緩効性カプセル若しくはマイクロカプセルとしてカプセル化形態で有効成分の組み合わせを含有していてもよい。

【0212】

普通、配合物は、0.01~90重量%の活性薬剤、0~20%の農学的に許容可能な界面活性剤、並びに、10~99.99%の固体又は液体不活性配合物及び補助剤を含み、活性薬剤は、少なくとも式(I)の化合物を、コンポーネント(B)及び(C)、及び、任意により他の活性薬剤、特に殺菌剤又は防腐剤等を一緒に伴って構成されている。組成物の濃縮形態は、一般に、約2~80%、好ましくは約5~70重量%の活性薬剤を含有する。配合物の適用形態は、例えば0.01~20重量%、好ましくは0.01~5重量%の活性薬剤を含有し得る。市販製品は濃縮物として配合されていることが好ましいであろうが、エンドユーザーは通常希釈した配合物を利用することとなる。

【0213】

市販の製品を濃縮物として配合することが好ましいが、エンドユーザーは通常配合物を希釈して使用するであろう。

【実施例】

【0214】

以下の実施例は本発明を例示するものである。本発明の一定の化合物は低施用量でのより高い効力により公知の化合物から区別可能であり、これは、実施例において概説されている実験手法を用い、必要に応じて、例えば50ppm、12.5ppm、6ppm、3ppm、1.5ppm、0.8ppm又は0.2ppmといったより少ない施用量を用いることで当業者により検証可能である。

【0215】

本明細書をとおして、温度は摂氏度で記載されており、「m.p.」は融点を意味する。LC/MSは液体クロマトグラフィー質量分光測定を意味し、装置及び方法の説明は以下のとおりである。

【0216】

方法G：

スペクトルを、エレクトロスプレーソース（極性：陽イオン又は陰イオン、キャピラリ：3.00kV、コーン範囲：30～60V、抽出器：2.00V、ソース温度：150、脱溶剤温度：350、コーンガス流：0l/Hr、脱溶剤ガス流：650l/Hr、質量範囲：100～900Da）及びWaters製のAcquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント及びダイオード-アレイ検出器を備えるWaters製の質量分光計（ACQUITY UPLC）（SQD、SQDI I又はZQシングル四重極型質量分光計）で記録した。溶剤デガッサ、バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント及びダイオード-アレイ検出器。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8μm、30×2.1mm、温度：60、DAD波長範囲（nm）：210～500、溶剤勾配：A = 水 + 5%のMeOH + 0.05%のHCOOH、B = アセトニトリル + 0.05%のHCOOH、勾配：1.2分間で10～100%のB；流量（ml/分）0.85

10

【0217】

方法H：

スペクトルを、エレクトロスプレーソース（極性：陽イオン又は陰イオン、キャピラリ：3.00kV、コーン範囲：30～60V、抽出器：2.00V、ソース温度：150、脱溶剤温度：350、コーンガス流：0L/Hr、脱溶剤ガス流：650L/Hr、質量範囲：100～900Da）及びWaters製のAcquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント及びダイオード-アレイ検出器を備えるWaters製の質量分光計（ACQUITY UPLC）（SQD、SQDI I又はZQシングル四重極型質量分光計）で記録した。溶剤デガッサ、バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント及びダイオード-アレイ検出器。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8μm、30×2.1mm、温度：60、DAD波長範囲（nm）：210～500、溶剤勾配：A = 水 + 5%のMeOH + 0.05%のHCOOH、B = アセトニトリル + 0.05%のHCOOH、勾配：2.7分間で10～100%のB；流量（ml/分）0.85

20

【0218】

方法I：

スペクトルを、エレクトロスプレーソース（極性：陽イオン又は陰イオン、キャピラリ（kV）3.5、コーン（V）30.00、抽出器（V）3.00、ソース温度（）150、脱溶剤温度（）400、コーンガス流（L/Hr）60、脱溶剤ガス流（L/Hr）700、質量範囲：140～800Da）及びWaters製のAcquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント及びダイオード-アレイ検出器を備えるWaters製の質量分光計（ACQUITY UPLC）（SQD、SQDI I又はZQシングル四重極型質量分光計）で記録した。溶剤デガッサ、バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント及びダイオード-アレイ検出器。溶剤デガッサ、バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント及びダイオード-アレイ検出器。カラム：Waters ACQUITY UPLC HSS T3；カラム長さ：30mm；カラムの内径：2.1mm；粒径：1.8μm；温度：60、DAD波長範囲（nm）：210～400。溶剤勾配A：水/メタノール9：1、0.1%ギ酸及び溶剤B：アセトニトリル、0.1%ギ酸

30

40

【0219】

50

【表 2】

時間 (分)	A (%)	B (%)	流量(ml/分)
0	100	0	0.75
2.5	0	100	0.75
2.8	0	100	0.75
3.0	100	0	0.75

【0 2 2 0】

配合例

【表 3】

水和剤	a)	b)	c)
有効成分[式(I)の化合物]	25 %	50 %	75 %
リグノスルホン酸ナトリウム	5 %	5 %	-
ラウリル硫酸ナトリウム	3 %	-	5 %
ナトリウムジイソブチルナフタレンスルホネート	-	6 %	10 %
フェノールポリエチレングリコールエーテル (7~8molのエチレンオキシド)	-	2 %	-
高分散ケイ酸	5 %	10 %	10 %
カオリン	62 %	27 %	-

10

20

【0 2 2 1】

有効成分を補助剤と十分に混合し、この混合物を好適なミル中において十分に粉砕することにより、水による希釈で所望の濃度の懸濁液を得ることが可能である水和剤が得られる。

【0 2 2 2】

【表 4】

乾燥種子処理に係る粉末	a)	b)	c)
有効成分[式(I)の化合物]	25 %	50 %	75 %
軽質鉱油	5 %	5 %	5 %
高分散ケイ酸	5 %	5 %	-
カオリン	65 %	40 %	-
タルカム	-	-	20 %

30

【0 2 2 3】

有効成分を補助剤と十分に混合し、この混合物を好適なミル中において十分に粉砕することにより、種子処理に直接用いられることが可能である粉末が得られる。

40

【0 2 2 4】

乳化性濃縮物

有効成分 [式 (I) の化合物] 10 %

オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル 3 %

(4 ~ 5 mol のエチレンオキシド)

ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 3 %

ヒマシ油ポリグリコールエーテル (3.5 mol のエチレンオキシド) 4 %

シクロヘキサノン 30 %

キシレン混合物 50 %

50

【 0 2 2 5 】

植物の保護において使用可能であるいずれかの所望の濃度のエマルジョンは、この濃縮物から、水による希釈によって得ることが可能である。

【 0 2 2 6 】

【表 5】

粉剤	a)	b)	c)
有効成分[式(I)の化合物]	5%	6%	4%
タルカム	95%	-	-
カオリン	-	94%	-
無機充填材	-	-	96%

10

【 0 2 2 7 】

すぐに使用可能な粉剤は、有効成分とキャリアとを混合し、混合物を好適なミル中において粉碎することにより得られる。このような粉末はまた、種子の乾燥粉衣に用いられることが可能である。

【 0 2 2 8 】

押出し顆粒

有効成分 [式 (I) の化合物] 15%

20

リグノスルホン酸ナトリウム 2%

カルボキシメチルセルロース 1%

カオリン 82%

【 0 2 2 9 】

有効成分を補助剤と共に混合及び粉碎し、この混合物を水で湿らせる。混合物を押し出し、次いで、空気流中において乾燥させる。

【 0 2 3 0 】

被覆顆粒

有効成分 [式 (I) の化合物] 8%

ポリエチレングリコール (m o l . w t . 2 0 0) 3%

30

カオリン 89%

【 0 2 3 1 】

ミキサ中において、ポリエチレングリコールで湿らせたカオリンに微細に粉碎した有効成分を均一に適用する。これにより、粉剤を含まない被覆顆粒が得られる。

【 0 2 3 2 】

懸濁液濃縮物

有効成分 [式 (I) の化合物] 40%

プロピレングリコール 10%

ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル (1 5 m o l のエチレンオキシド) 6%

40

リグノスルホン酸ナトリウム 10%

カルボキシメチルセルロース 1%

シリコン油 (水中に 7 5 % エマルジョンの形態) 1%

水 32%

【 0 2 3 3 】

細かく粉碎した有効成分を補助剤と均質に混合して懸濁液濃縮物を得、水で希釈することによって、この懸濁液を任意の所望の濃度で得ることが可能である。このような希釈を用いることで、吹付け、注ぎかけ、又は、浸漬により、微生物による外寄生から、生存している植物並びに植物繁殖体を処理及び保護可能である。

【 0 2 3 4 】

50

種子処理用流動性濃縮物

有効成分 [式 (I) の化合物] 40%

プロピレングリコール 5%

コポリマーブタノール P O / E O 2%

トリスチレンフェノール + 10 ~ 20 モル E O 2%

1, 2 - ベンズイソチアゾリン - 3 - オン (水中に 20 % 溶液の形態) 0.5%

モノアゾ顔料カルシウム塩 5%

シリコーン油 (水中に 75 % エマルジョンの形態) 0.2%

水 45.3%

【 0 2 3 5 】

細かく粉碎した有効成分を補助剤と均質に混合して懸濁液濃縮物を得、水で希釈することによって、この懸濁液を任意の所望の濃度で得ることが可能である。このような希釈を用いることで、吹付け、注ぎかけ、又は、浸漬により、微生物による外寄生から、生存している植物並びに植物繁殖体を処理及び保護可能である。

【 0 2 3 6 】

緩効性カプセル懸濁液

28部の組み合わせた式 (I) の化合物を、2部の芳香族溶剤及び7部のトルエンジイソシアネート / ポリメチレン - ポリフェニルイソシアネート混合物 (8 : 1) と混合する。この混合物を、1.2部のポリビニルアルコール、0.05部の脱泡剤及び51.6部の水の混合物中において、所望の粒径が達成されるまで乳化させる。このエマルジョンに、5.3部の水中の2.8部の1, 6 - ジアミノヘキサンの混合物を添加する。この混合物を、重合反応が完了するまで攪拌する。

【 0 2 3 7 】

得られるカプセル懸濁液を、0.25部の増粘剤及び3部の分散剤を添加することにより安定化させる。カプセル懸濁液配合物は、28%の有効成分を含有する。中程度のカプセル径は8 ~ 15ミクロンである。

【 0 2 3 8 】

得られる配合物を、目的に好適な装置中において、水性懸濁液として種子に適用する。

【 0 2 3 9 】

調製例

実施例 1 : この例は、2 - [(5 - クロロ - 2 - チエニル) メチル] - N - (8 - フルオロ - 3 - キノリル) - 2 , 4 - ジメチル - ペンタンアミドの調製を例示する。

ステップ 1 : エチル 2 - [(5 - クロロ - 2 - チエニル) メチル] - 2 , 4 - ジメチル - ペンタノエートの調製

- 70 でテトラヒドロフラン (0.25 M、9.1 mL) 中のエチル 2 , 4 - ジメチルペンタノエート (0.36 g、2.28 mmol) の溶液に、リチウムジイソプロピルアミド (THF 中 2 M、1.3 当量、1.5 mL、2.96 mmol) の溶液を添加した。溶液を - 70 で 1 時間攪拌した。次いで、2 - クロロ - 5 - (クロロメチル) チオフェン (1.3 当量、0.37 mL、2.96 mmol) を添加し、オレンジ色の溶液を室温に温め、この温度で 16 時間攪拌した。反応混合物を飽和 NH₄Cl 水溶液でクエンチした。2つの相を分離させ、水性相を酢酸エチルで 2 回抽出した。組み合わせられた有機相を塩水で洗浄し、無水 Na₂SO₄ で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。フラッシュクロマトグラフィによる残渣の精製により、エチル 2 - [(5 - クロロ - 2 - チエニル) メチル] - 2 , 4 - ジメチル - ペンタノエート (0.25 g、38% の収率) を黄色の液体として得た。LC - MS (方法 G) , R_t = 1.35 分 ;

¹H NMR (400 MHz , クロロホルム - d) ppm 0.91 (d , 6 H) 1.15 (s , 3 H) 1.28 (t , 3 H) 1.45 (m , 1 H) 1.68 - 1.75 (m , 2 H) 2.71 (d , 1 H) 3.19 (d , 1 H) 4.14 (q , 2 H) 6.52 (d , 1 H) 6.70 (d , 1 H) .

【 0 2 4 0 】

10

20

30

40

50

ステップ 2 : 2 - [(5 - クロロ - 2 - チエニル) メチル] - N - (8 - フルオロ - 3 - キノリル) - 2 , 4 - ジメチル - ペンタンアミドの調製。

エチル 2 - [(5 - クロロ - 2 - チエニル) メチル] - 2 , 4 - ジメチル - ペンタノエート (0 . 0 7 5 g , 0 . 2 6 m m o l , 1 . 0 5 当量) のトルエン (0 . 2 2 M , 1 . 2 m L) 中の溶液に、8 - フルオロキノリン - 3 - アミン (1 . 0 当量、0 . 0 4 0 g、0 . 2 5 m m o l) を添加し、続いて、トリメチルアルミニウムの溶液 (トルエン中に 2 M) (1 . 3 当量、0 . 1 6 m L、0 . 3 2 m m o l) を滴下した。この茶色の溶液を 9 0 で 1 6 時間攪拌した。反応混合物を、水酸化ナトリウム水溶液 (1 M) を添加することにより失活させた。2 つの相を分離し、水性相をジクロロメタンで抽出した。有機相を塩水で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。フラッシュクロマトグラフィ

10

による残渣の精製で、2 - [(5 - クロロ - 2 - チエニル) メチル] - N - (8 - フルオロ - 3 - キノリル) - 2 , 4 - ジメチル - ペンタンアミド (0 . 0 3 8 g、3 8 % 収率) をベージュ色の固体として得た。mp = 1 4 2 ~ 1 4 5 ; LC - MS (方法 G) , R t = 1 . 2 2 分 ;

¹H NMR (4 0 0 M H z , クロロホルム - d) ppm 0 . 8 7 (d , 3 H) 0 . 9 3 (d , 3 H) 1 . 3 5 (s , 3 H) 1 . 4 8 (d d , 1 H) 1 . 7 8 (m , 1 H) 1 . 9 0 (d d , 1 H) 2 . 7 3 (d , 1 H) 3 . 3 4 (d , 1 H) 6 . 5 2 (d , 1 H) 6 . 6 5 (d , 1 H) 7 . 2 9 (t , 1 H) 7 . 4 4 (m , 1 H) 7 . 5 5 (d , 1 H) 7 . 6 3 (s , 1 H , N H) 8 . 6 2 (s , 1 H) 8 . 8 0 (s , 1 H) .

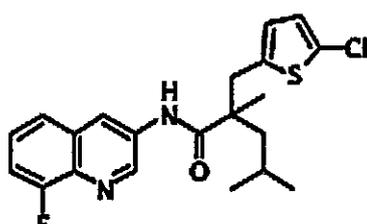
【 0 2 4 1 】

20

【 表 6 】

表 E:

式(I)の化合物の物理データ

項目	構造	RT (分)	[M+H] (実測値)	方法	MP°C
E1		1.22	407	G	142 - 145

30

【 0 2 4 2 】

生物学的実施例

ボトリオチニアフッケリアナ (*Botryotinia fuckeliana*) (ボトリチス シネレア (*Botrytis cinerea*)) / 液体培養 (灰色カビ病)

極低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地 (Vogel s 液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 3 ~ 4 日間後に、成長の阻害を測光法により測定する。

40

【 0 2 4 3 】

以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比した場合に、20 ppm でボトリオチニアフッケリアナ (*Botryotinia fuckeliana*) の少なくとも 80 % 防除をもたらした :

E 1 .

【 0 2 4 4 】

グロメララゲナリウム (*Glomerella lagenarium*) (コレトトリ

50

カムラゲナリウム (*Colletotrichum lagenarium*) / 液体培養 (炭疽病)

低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地 (PDB ジャガイモブドウ糖液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 3 ~ 4 日後に、成長の阻害を測光法により計測する。
【0245】

以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比して、20 ppm で、グロメレララゲナリウム (*Glomerella lagenarium*) の少なくとも 80 % 防除をもたらした：

E 1。

【0246】

フザリウムクルモルム (*Fusarium culmorum*) / 液体培養 (胴枯れ病)

極低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地 (PDB ジャガイモブドウ糖液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 3 ~ 4 日間後に、成長の阻害を測光法により測定する。

【0247】

以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比した場合に、20 ppm でフザリウムクルモルム (*Fusarium culmorum*) の少なくとも 80 % 防除をもたらした：

E 1。

【0248】

ゲーウマノミセスグラミニス (*Gaeumannomyces graminis*) / 液体培養 (穀類の立枯病)

極低温保管しておいた真菌の菌糸断片を栄養液体培地 (PDB ジャガイモブドウ糖液体培地) に直接混合した。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 4 ~ 5 日間後に、成長の阻害を測光法により測定する。

【0249】

以下の化合物が、大幅な病害の発生を示した未処理の対照と同一の条件下で比した場合に、20 ppm で、ゲーウマノミセスグラミニス (*Gaeumannomyces graminis*) の少なくとも 80 % 防除をもたらした：

E 1。

【0250】

モノグラフェラニバリス (*Monographella nivalis*) (コムギ赤かび病菌 (*Microdochium nivale*)) / 液体培養 (穀類の根腐れ病)

極低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地 (PDB ジャガイモブドウ糖液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 4 ~ 5 日間後に、成長の阻害を測光法により測定する。

【0251】

以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生が見られた未処理の対照と比した場合に、20 ppm でモノグラフェラニバリス (*Monographella nivalis*) の少なくとも 80 % 防除をもたらした：

E 1。

【0252】

10

20

30

40

50

マグナポルテ グリセア (Magnaporthe oryzae) (イネいもち病菌 (Pyricularia oryzae)) / 液体培養 (稲熱病)

極低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地 (PDBジャガイモブドウ糖液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96ウェル型) に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を加える。テストプレートを24でインキュベートし、適用から3~4日間後に、成長の障害を測光法により測定する。

【0253】

以下の化合物が、大幅な病害の発生を示した未処理の対照と同一の条件下で比した場合に、20ppmで、マグナポルテ グリセア (Magnaporthe oryzae) の少なくとも80%防除をもたらした：

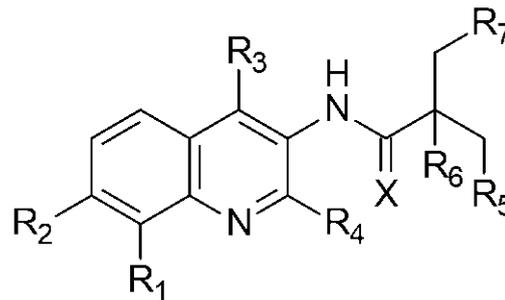
10

E1。

本発明のまた別の態様は、以下のとおりであってもよい。

〔1〕式(I)：

【化16】



20

(I)

(式中、

Xは、O又はSであり；

R1は、水素、ハロゲン、メチル又はシアノであり；

R2は、水素、メチル又はハロゲンであり；

30

R3及びR4は各々、水素、ハロゲン及びメチルから独立して選択され；

R5は、C1~C4アルキル、C2~C4アルケニル又はC3~C6シクロアルキルであり、ここで、前記アルキル、アルケニル及びシクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、C1~C3アルキル、C1~C3ハロアルキル、C1~C3アルコキシ及びC1~C3アルキルチオから独立して選択される1~3個の置換基で任意に置換されていてもよく；

R6は、水素、フルオロ、クロロ、シアノ又はC1~C4アルキルであり；

R7は、C4~C10飽和若しくは部分不飽和複素環又はヘテロアリールであり、ここで、前記複素環又はヘテロアリールは、N、O及びSから選択される1個、2個又は3個のヘテロ原子を含有し、炭素又は窒素原子を介して結合され、ハロゲン、シアノ、C1~C3アルキル、C1~C3アルコキシ、C1~C3アルキルチオ、C1~C3ハロアルキル、C1~C3ハロアルコキシ、C1~C3ハロアルキルチオ及びC3~C5シクロアルキルから独立して選択される1個以上の置換基で任意に置換されていてもよい)

40

の化合物；

又はその塩、鏡像異性体若しくはN-オキシド。

〔2〕R1が、水素、フルオロ、クロロ、メチル又はシアノである、前記〔1〕に記載の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくはN-オキシド。

〔3〕R2が、水素、メチル、クロロ又はフルオロである、前記〔1〕又は〔2〕に記載の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくはN-オキシド。

〔4〕R3及びR4が各々、水素及びメチルから独立して選択される、前記〔1〕、〔2〕又は〔3〕のいずれか一項に記載の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくはN-オキシ

50

ド。

〔 5 〕 R_5 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、ここで、前記アルキル、アルケニル及びシクロアルキルは、フルオロ、クロロ及び $C_1 \sim C_3$ アルキルから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されていてもよい、前記〔 1 〕、〔 2 〕、〔 3 〕又は〔 4 〕のいずれか一項に記載の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシド。

〔 6 〕 R_6 が、水素、フルオロ、クロロ又は $C_1 \sim C_3$ アルキルである、前記〔 1 〕、〔 2 〕、〔 3 〕、〔 4 〕、又は 5 のいずれか一項に記載の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシド。

〔 7 〕 R_7 が、チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル（ここで、環員メチレン基のうちの 1 つは、 $C = O$ 、 $C = CH_2$ 又は $C = CF_2$ を任意に表し得る）、ピリダジニル、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピリダジニル又はピリジニルであり、ここで、前記チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル、ピリダジニル、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピリダジニル及びピリジニルは、フルオロ、クロロ、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル及び $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルから独立して選択される 1 個以上の置換基で任意に置換されていてもよい、前記〔 1 〕、〔 2 〕、〔 3 〕、〔 4 〕、5 又は 6 のいずれか一項に記載の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシド。

〔 8 〕 R_1 が、水素、フルオロ、クロロ又はメチルであり； R_2 が、水素、クロロ又はフルオロであり； R_3 がメチルであり、かつ R_4 が水素であるか；又は R_3 が水素であり、かつ R_4 がメチルであるか；又は R_3 が水素であり、かつ R_4 が水素であり； R_5 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルケニル、シクロプロピル又はシクロブチルであり、ここで、前記アルキル、アルケニル、シクロプロピル及びシクロブチルは、フルオロ及びクロロから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基又は 1 個のメチル基で任意に置換されていてもよく； R_6 が、水素、フルオロ、クロロ又はメチルである、前記〔 1 〕、〔 2 〕、〔 3 〕、〔 4 〕、5、6 又は 7 のいずれか一項に記載の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシド。

〔 9 〕 R_7 が、チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル（ここで、環員メチレン基のうちの 1 つは、 $C = CF_2$ を任意に表し得る）、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピリダジニル又はピリジニルであり、ここで、前記チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4, 5 - ジヒドロ - 3 H - ピリダジニル及びピリジニルは、フルオロ、クロロ、メチル、トリフルオロメチル及びシクロプロピルから独立して選択される 1 個又は 2 個の置換基で任意に置換されていてもよい、前記〔 1 〕、〔 2 〕、〔 3 〕、〔 4 〕、5、6、7 又は 8 のいずれか一項に記載の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくは N - オキシド。

〔 10 〕 X が、O 又は S であり； R_1 が、水素、フルオロ、クロロ又はメチルであり； R_2 が、水素、クロロ又はフルオロであり； R_3 がメチルであり、かつ R_4 が水素であるか；又は R_3 が水素であり、かつ R_4 がメチルであるか；又は R_3 が水素であり、かつ R_4 が水素であり； R_5 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_3$ アルケニル、シクロプロピル又はシクロブチルであり、ここで、前記アルキル、アルケニル、シクロプロピル及びシクロブチルは、フルオロ及びクロロから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基又は 1 個のメチル基で任意に置換されていてもよく； R_6 が、水素、フルオロ、クロロ又はメチルであり； R_7 が、チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル（ここで、環員メチレン基のうちの 1 つは、 $C = CF_2$

10

20

30

40

50

を任意に表し得る)、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4,5-ジヒドロ-3H-ピリダジニル又はピリジニルであり、ここで、前記チエニル、アゼチジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル、オキサジナニル、チオモルホリニル、モルホリニル、インダゾリル、4,5-ジヒドロ-3H-ピリダジニル及びピリジニルは、フルオロ、クロロ、メチル、トリフルオロメチル及びシクロプロピルから独立して選択される1個又は2個の置換基で任意に置換されていてもよい、前記〔1〕に記載の化合物；又はその塩、鏡像異性体若しくはN-オキシド。

〔1.1〕Xが、O又はSであり；R₁が、フルオロ、クロロ又はメチルであり；R₂が、水素又はフルオロであり；R₃及びR₄が共に水素であり；R₅は、トリフルオロメチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル、C₂-アルケニル又はシクロプロピルであり、ここで、前記エチル、イソプロピル、アルケニル及びシクロプロピルは、フルオロ及びクロロから独立して選択される1~3個の置換基又は1個のメチル基で任意に置換されていてもよく；R₆が、メチルであり；R₇が、チエニル、アゼチジニル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル（ここで、環員メチレン基のうちの1つは、C=C F₂を任意に表し得る）又はピリジニルであり、ここで、前記チエニル、アゼチジニル、チアゾリル、ピロリジニル、ピペリジル、及びピリジニルは、フルオロ、クロロ、メチル又はトリフルオロメチルから独立して選択される1個又は2個の置換基で任意に置換されていてもよい、前記〔1〕に記載の化合物；又はその塩、鏡像異性体若しくはN-オキシド。

〔1.2〕XがOである、前記〔1〕、〔2〕、〔3〕、〔4〕、5、6、7、8、9、10又は11のいずれか一項に記載の化合物、又はその塩、鏡像異性体若しくはN-オキシド。

〔1.3〕殺菌・殺カビ的に有効な量の前記〔1〕~〔1.2〕のいずれかに定義されている式(I)の化合物を含む組成物。

〔1.4〕少なくとも1種の追加の有効成分及び/又は希釈剤をさらに含む、前記〔1.3〕に記載の組成物。

〔1.5〕植物病原性真菌の駆除、予防又は防除方法であって、植物病原性真菌、前記植物病原性真菌の生息地、又は、植物病原性真菌による被害を受けやすい植物、又は、その繁殖体に、殺菌・殺カビ的に有効な量の前記〔1〕~〔1.2〕のいずれかに定義されている式(I)の化合物、又は、殺菌・殺カビ的に有効な量の前記〔1〕~〔1.2〕のいずれかに定義されている式(I)の化合物を含む組成物を適用する工程を含む、方法。

10

20

30

40

50

フロントページの続き

- (74)代理人 100111796
弁理士 服部 博信
- (74)代理人 100196405
弁理士 小松 邦光
- (72)発明者 ボウ ハムダン ファルハン
スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ クロップ プロテク
ション アクチェンゲゼルシャフト内
- (72)発明者 ヴァイス マティアス
スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ クロップ プロテク
ション アクチェンゲゼルシャフト内
- (72)発明者 クアランタ ローラ
スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ クロップ プロテク
ション アクチェンゲゼルシャフト内
- 審査官 水島 英一郎
- (56)参考文献 国際公開第2004/039783(WO, A1)
国際公開第2004/055261(WO, A1)
特開昭61-126071(JP, A)
特開2004-115435(JP, A)
- (58)調査した分野 (Int.Cl., DB名)
C07D
CAplus(STN)
REGISTRY(STN)