

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第6492101号  
(P6492101)

(45) 発行日 平成31年3月27日 (2019. 3. 27)

(24) 登録日 平成31年3月8日 (2019. 3. 8)

(51) Int. Cl.	F I
CO7D 487/04 (2006.01)	CO7D 487/04 140
AO1P 3/00 (2006.01)	CO7D 487/04 142
AO1N 43/90 (2006.01)	CO7D 487/04 144
	AO1P 3/00
	AO1N 43/90 103
請求項の数 14 (全 101 頁) 最終頁に続く	

(21) 出願番号	特願2016-555604 (P2016-555604)	(73) 特許権者	300091441
(86) (22) 出願日	平成27年2月26日 (2015. 2. 26)		シンジェンタ パーティシペーションズ
(65) 公表番号	特表2017-508752 (P2017-508752A)		アーゲー
(43) 公表日	平成29年3月30日 (2017. 3. 30)		スイス国4058 バーゼル、シュバルツ
(86) 国際出願番号	PCT/EP2015/054080		バルトアレー 215
(87) 国際公開番号	W02015/132133	(74) 代理人	100086771
(87) 国際公開日	平成27年9月11日 (2015. 9. 11)		弁理士 西島 孝喜
審査請求日	平成30年2月21日 (2018. 2. 21)	(74) 代理人	100088694
(31) 優先権主張番号	14157717.1		弁理士 弟子丸 健
(32) 優先日	平成26年3月4日 (2014. 3. 4)	(74) 代理人	100094569
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)		弁理士 田中 伸一郎
		(74) 代理人	100084663
			弁理士 箱田 篤
		(74) 代理人	100093300
			弁理士 浅井 賢治
最終頁に続く			

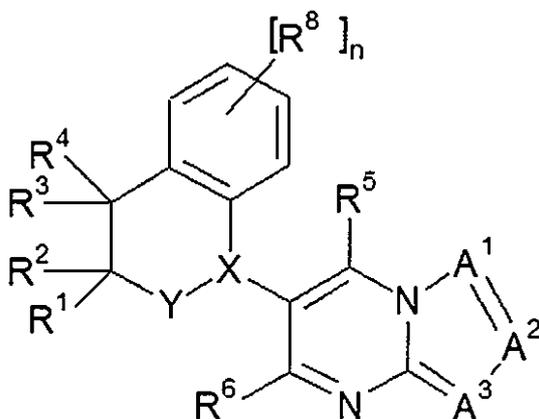
(54) 【発明の名称】 殺微生物性二環式複素環式誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I の化合物

【化1】



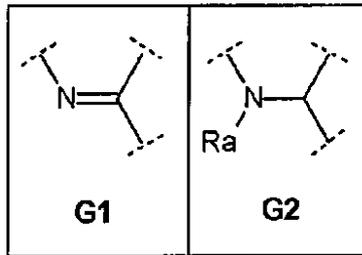
(式中、

A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>およびA<sup>3</sup>の各々は、独立して、窒素原子またはC R<sup>7</sup>を表し、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>および

$A^3$ の2つ以上が $CR^7$ を表し；

Y - Xは、G1又はG2から選択される基を表し；

【化2】



10

$R^1$ および $R^2$ は各々、 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され、ここで、前記アルキル基は、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_6$ アルコキシ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；または

$R^1$ および $R^2$ は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基を表し；

$R^3$ および $R^4$ は各々、水素、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され；または

20

$R^3$ および $R^4$ は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ またはシクロプロピルを表し；

$R^5$ は、水素またはハロゲンであり；

$R^6$ は、水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

各 $R^7$ は独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはヒドロキシルを表し；

各 $R^8$ は独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、フェニル、ヘテロアリールであってピリジル、チオフェニルまたはチアゾリルである該ヘテロアリール、フェノキシ、またはヘテロアリールオキシであって該ヘテロアリールはピリジル、チオフェニルまたはチアゾリルであるヘテロアリールオキシを表し、ここで、前記アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲンからなる群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、ならびに、前記フェニル、フェノキシおよびヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、または1～3個のハロゲン原子で置換されている $C_1 \sim C_3$ アルキルからなる群から独立して選択される1または2個の置換基で置換されていてもよく；nは0、1または2であり；

30

$R^a$ は、水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルである）  
または、その塩もしくはN - オキシド。

【請求項2】

$A_1$ 、 $A_2$ および $A_3$ のすべてが $CR^7$ を表す、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

各 $R^7$ が独立して、水素またはハロゲンを表す、請求項1または2に記載の化合物。

40

【請求項4】

Y - Xが、G1である、請求項1、2または3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項5】

$R^1$ および $R^2$ が各々、 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択されるか；または、 $R^1$ および $R^2$ が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、シクロプロピル基を表す、請求項1、2、3または4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

$R^3$ および $R^4$ が各々、水素、フルオロもしくはメチルから独立して選択されるか；または、 $R^3$ および $R^4$ が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ を表す、請求項1、2、3、4または5のいずれか一項に記載の化合物。

50

## 【請求項 7】

R<sup>5</sup>が、水素である、請求項 1、2、3、4、5 または 6 のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 8】

R<sup>6</sup>が、水素である、請求項 1、2、3、4、5、6 または 7 のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 9】

各 R<sup>8</sup>が独立して、フルオロ、クロロ、ブロモ、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルコキシ、フェニル、ピリジル、フェノキシまたはピリジロキシを表し、ここで、前記アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲンからなる群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、ならびに、前記フェニルおよびピリジル基は、ハロゲンからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で置換されていてもよく；n が、0、1 または 2 である、請求項 1、2、3、4、5、6、7 または 8 のいずれか一項に記載の化合物。

10

## 【請求項 10】

請求項 1 に記載の化合物であって、A<sup>1</sup>が窒素原子を表し、かつ A<sup>2</sup>および A<sup>3</sup>の両方が C R<sup>7</sup>を表すか、または A<sup>2</sup>が窒素原子を表し、かつ A<sup>1</sup>および A<sup>3</sup>の両方が C R<sup>7</sup>を表し；各 R<sup>7</sup>が独立して、水素またはハロゲンを表し；Y - X が、G 1 又は G 2 であり；R<sup>1</sup>および R<sup>2</sup>が各々、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルから独立して選択されるか；または、R<sup>1</sup>および R<sup>2</sup>が、これらが結合している炭素原子と一緒に、シクロプロピル基を表し；R<sup>3</sup>および R<sup>4</sup>が各々、水素、フルオロもしくはメチルから独立して選択されるか；または、R<sup>3</sup>および R<sup>4</sup>が、これらが結合している炭素原子と一緒に、C = O を表し；R<sup>5</sup>が、水素、クロロまたはフルオロを表し；R<sup>6</sup>が、水素またはメチルを表し；各 R<sup>8</sup>が独立して、フルオロ、クロロ、ブロモ、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルコキシ、フェニル、ピリジル、フェノキシまたはピリジロキシを表し、ここで、前記アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲンからなる群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、ならびに、前記フェニルおよびピリジル基は、ハロゲンからなる群から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で置換されていてもよく；n が、0、1 または 2 であり；R<sup>a</sup>が、水素または C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキルである化合物、または、その塩もしくは N - オキシド。

20

## 【請求項 11】

請求項 1 に記載の化合物であって、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>および A<sup>3</sup>のすべてが C R<sup>7</sup>を表し；各 R<sup>7</sup>が独立して、水素、フルオロまたはクロロを表し、ここで、2 つ以上の R<sup>7</sup>基がフルオロまたはクロロであることはなく；Y - X が G 1 であり；R<sup>1</sup>および R<sup>2</sup>が各々、C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキルから独立して選択され；R<sup>3</sup>および R<sup>4</sup>が各々、水素、フルオロまたはメチルから独立して選択され；R<sup>5</sup>が水素であり；R<sup>6</sup>が水素であり；各 R<sup>8</sup>が独立して、フルオロ、クロロ、ブロモ、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキルまたは C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルコキシを表し、ここで、前記アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲンからなる群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；n が、0 または 1 である化合物、または、その塩もしくは N - オキシド。

30

## 【請求項 12】

殺真菌的に有効な量の請求項 1 ~ 11 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。

40

## 【請求項 13】

少なくとも 1 種の追加の活性成分および / または希釈剤をさらに含む、請求項 12 に記載の組成物。

## 【請求項 14】

植物病原性微生物の駆除、予防または防除方法であって、植物病原体、前記植物病原体の生息地、または、植物病原体による被害を受けやすい植物、または、その繁殖体に、殺真菌的に有効な量の請求項 1 ~ 11 のいずれかに定義されている式 (I) の化合物、または、殺真菌的に有効な量の請求項 1 ~ 11 のいずれかに定義されている式 (I) の化合物

50

を含む組成物を適用することを含む、前記方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、例えば、特に殺真菌活性といった殺微生物活性を有する活性成分としての殺微生物二環式複素環式誘導体に関する。本発明はまた、これらの二環式複素環式誘導体の調製、これらの二環式複素環式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種の二環式複素環式誘導体を含む農芸化学組成物、これらの組成物の調製、および、農業または園芸における、植物、収穫された食品作物、種子また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もしくは予防するための二環式複素環式誘導体または組成物の使用に関する。

10

【背景技術】

【0002】

一定の殺真菌性 (fungicidal) ヘテロ二環式化合物が国際公開第05070917号パンフレットに記載されている。

【0003】

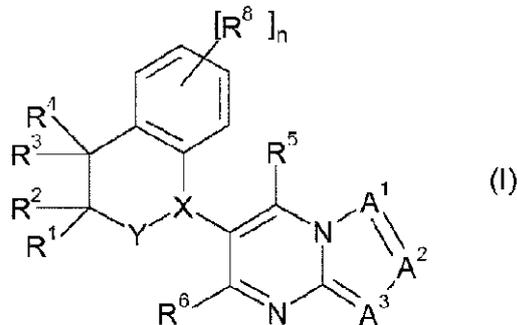
意外なことに、一定の新規二環式複素環式誘導体が有利な殺真菌特性を有することがここに見いだされた。

【発明の概要】

【0004】

本発明は従って、式Iの化合物

【化1】



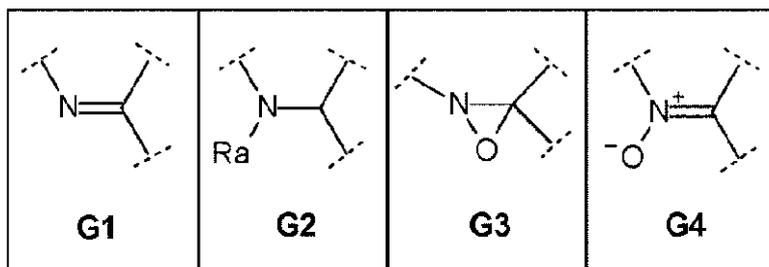
30

(式中、

A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>およびA<sup>3</sup>の各々は、独立して、窒素原子またはC R<sup>7</sup>を表し；

Y - Xは、G1、G2、G3およびG4から選択される基を表し；

【化2】



40

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は各々、水素、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>7</sub>シクロアルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニルから独立して選択され、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、ハロゲン、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルチオおよびフェノキシから独立して選択される1~3個の置換基で任意選択により置換され得；または

50

$R^1$ および $R^2$ は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル基（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよびフェノキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得る）を表し；

$R^3$ および $R^4$ は各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルから独立して選択され、ここで、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオおよびフェノキシから独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得；または

$R^3$ および $R^4$ は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ 、 $C=CH_2$ または $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよびフェノキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得る）を表し；

$R^5$ は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシまたはヒドロキシルであり；

$R^6$ は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシまたはヒドロキシルであり；

各 $R^7$ は独立して、水素、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルまたはヒドロキシルを表し；

各 $R^8$ は独立して、ヒドロキシル、ハロゲン、シアノ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、 $CO_2H$ 、 $CO_2(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $C(O)N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、 $C(O)NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $C(O)NH_2$ 、 $NH(C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル)、 $N(C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル) $_2$ 、アリール、ヘテロアリール、アリールオキシまたはヘテロアリールオキシを表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルおよびフェノキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、アリールまたはヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル（これ自体は、1～3個のハロゲン原子で任意選択により置換され得る）、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、アミノ（これ自体は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルから独立して選択される1個または2個の基で置換され得る）、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、メルカプトおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～5個の置換基で任意選択により置換され得；nは0、1、2、3または4であり；

$R^9$ は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオおよびフェノキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得る）または、その塩もしくはN-オキシドを提供する。

【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)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物は、植物病原体に直接、または、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】

10

20

30

40

50

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)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物の使用を提供する。

【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)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物を、前記植物病原体、または、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)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物の使用を提供する。

【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)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物を、前記植物病原性真菌、または、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個以上の同等もしくは異なる置換基、例えば1~3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。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)。

【0013】

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

【0014】

アルキル置換基は直鎖または分岐であり得る。アルキルは、それ自体、または、他の置換基の一部として、記載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-ヘキシルおよびこれらの異性体、例えば、イソ-プロピル、イソ-ブチル、sec-ブチル、t-ブチルまたはイソ-アミルである。

【0015】

アルケニル置換基は直鎖または分岐鎖の形態であることが可能であり、このアルケニル部分は、適切な場合、(E)-または(Z)-立体構成のものであることが可能である。例はビニルおよびアリルである。アルケニル基は、好ましくは $C_2 \sim C_6$ 、より好ましくは $C_2 \sim C_4$ 、および、最も好ましくは $C_2 \sim C_3$ アルケニル基である。

【0016】

アルキニル置換基は、直鎖または分岐鎖の形態であることが可能である。例はエチニルおよ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 $C_2 \sim C_4$ 、および、最も好ましくは $C_2 \sim C_3$ アルキニル基である。

【0017】

ハロアルキル基は1個以上の同等または異なるハロゲン原子を含有し得、例えば、 $CH_2Cl$ 、 $CHCl_2$ 、 $CCl_3$ 、 $CH_2F$ 、 $CHF_2$ 、 $CF_3$ 、 $CF_3CH_2$ 、 $CH_3CF_2$ 、 $CF_3CF_2$ または $CCl_3CCl_2$ を表し得る。

【0018】

ハロアルケニル基はそれぞれアルケニル基であり、これらは、1つ以上の同一または異なるハロゲン原子で置換されており、例えば、2,2-ジフルオロビニルまたは1,2-ジクロロ-2-フルオロ-ビニルである。

【0019】

10

20

30

40

50

ハロアルキニル基はそれぞれアルキニル基であり、これらは、1つ以上の同一また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-プロポ-2-イニルである。

【0020】

アルコキシは基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-メチルプロポキシおよび2-メチルプロポキシが挙げられる。

【0021】

シアノは-CN基を意味する。

【0022】

アミノは-NH<sub>2</sub>基を意味する。

【0023】

ヒドロキシルまたはヒドロキシは、-OH基を指す。

【0024】

アリール基(単独で、または、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、二環式また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、インデニルまた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およびナフチルであり、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。

【0025】

ヘテロアリール基(単独で、または、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、単一の環または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、酸素およ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、イソチアゾリルおよ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およ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。

【0026】

ヘテロシクリル基または複素環(単独で、または、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およびNから選択される1個以上(好ましくは1個、2個または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]ジオキサラニル、ピペリジニル、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]トリアジナニルおよびモルホリニル、または、1-オキソ-チエタニルおよび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]ジオキサラニル、ベンゾ[1,3]ジオキサラニル、クロメニルおよび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。

10

20

30

40

50

## 【0027】

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、鏡像異性形態また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およ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およ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。

## 【0028】

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、または、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。

10

## 【0029】

N-オキシドは、第三級アミンの酸化型、または、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. Albini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991に記載されている。

## 【0030】

Y-X、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、Raおよびnの好ましい値は、任意のこれらの組み合わせで、以下に規定されているとおりである。

## 【0031】

好ましくは、A<sub>1</sub>、A<sub>2</sub>およびA<sub>3</sub>の1つ以上はCR<sup>7</sup>を表す。

20

## 【0032】

より好ましくは、A<sub>1</sub>、A<sub>2</sub>およびA<sub>3</sub>の2つ以上はCR<sup>7</sup>を表す。

## 【0033】

さらにより好ましくは、A<sub>1</sub>は窒素原子であり、ならびに、A<sub>2</sub>およびA<sub>3</sub>は共にCR<sup>7</sup>を表し、または、A<sub>2</sub>は窒素原子であり、ならびに、A<sub>1</sub>およびA<sub>3</sub>は共にCR<sup>7</sup>を表す。

## 【0034】

最も好ましくは、A<sub>1</sub>、A<sub>2</sub>およびA<sub>3</sub>はすべてCR<sup>7</sup>を表す。

## 【0035】

好ましくは、各R<sup>7</sup>は独立して、水素、ハロゲン、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニルまたはヒドロキシルを表す。

30

## 【0036】

より好ましくは、各R<sup>7</sup>は独立して、水素、ハロゲン、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルまたはヒドロキシルを表す。

## 【0037】

さらにより好ましくは、各R<sup>7</sup>は独立して、水素またはハロゲンを表す。

## 【0038】

最も好ましくは、各R<sup>7</sup>は独立して、水素、フルオロまたはクロロであり、ここで、2つ以上のR<sup>7</sup>基がフルオロまたはクロロであることはない。

40

## 【0039】

好ましくは、Y-Xは、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>またはG<sub>4</sub>である。

## 【0040】

より好ましくは、Y-XはG<sub>1</sub>またはG<sub>2</sub>である。

## 【0041】

最も好ましくは、Y-XはG<sub>1</sub>である。

## 【0042】

好ましくは、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は各々、水素、シアノ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>7</sub>シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、ハロゲン、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシおよびC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルチオから独立して選択される1~3個の置

50

換基で任意選択により置換され得；または、 $R^1$ および $R^2$ は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基を表す。

【0043】

より好ましくは、 $R^1$ および $R^2$ は各々、 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され、ここで、アルキル基は、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得；または、 $R^1$ および $R^2$ は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基を表す。

【0044】

さらにより好ましくは、 $R^1$ および $R^2$ は各々 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され；または、 $R^1$ および $R^2$ は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、シクロプロピル基を表す。

10

【0045】

最も好ましくは、 $R^1$ および $R^2$ は各々 $C_1 \sim C_2$ アルキルから独立して選択される。

【0046】

好ましくは、 $R^3$ および $R^4$ は各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択され、ここで、アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得；または、 $R^3$ および $R^4$ は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ もしくは $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル（これは、ハロゲンから独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得る）を表す。

20

【0047】

より好ましくは、 $R^3$ および $R^4$ は各々、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され；または、 $R^3$ および $R^4$ は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ またはシクロプロピルを表す。

【0048】

さらにより好ましくは、 $R^3$ および $R^4$ は各々、水素、フルオロもしくはメチルから独立して選択され；または、 $R^3$ および $R^4$ は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ を表す。

【0049】

最も好ましくは、 $R^3$ および $R^4$ は各々、水素、フルオロまたはメチルから独立して選択される。

30

【0050】

好ましくは、 $R^5$ は、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0051】

より好ましくは、 $R^5$ は水素またはハロゲンである。

【0052】

さらにより好ましくは、 $R^5$ は水素、クロロまたはフルオロである。

【0053】

最も好ましくは、 $R^5$ は水素である。

【0054】

好ましくは、 $R^6$ は、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである；

40

【0055】

より好ましくは、 $R^6$ は水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0056】

さらにより好ましくは、 $R^6$ は水素またはメチルである。

【0057】

最も好ましくは、 $R^6$ は水素である。

【0058】

好ましくは、各 $R^8$ は独立して、ヒドロキシル、ハロゲン、シアノ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、

50

$C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、フェニル、ヘテロアリアル（式中、ヘテロアリアルは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリアルオキシ（式中、ヘテロアリアルは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）を表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ヒドロキシルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、フェニル、フェノキシおよびヘテロアリアル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル（これ自体は、1～3個のハロゲン原子で任意選択により置換され得る）または $C_1 \sim C_6$ アルコキシからなる群から独立して選択される1～5個の置換基で任意選択により置換され得；nは、0、1、2、または3である。

10

## 【0059】

より好ましくは、各 $R^8$ は独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、フェニル、ヘテロアリアル（式中、ヘテロアリアルは、ピリジル、チオフェニルまたはチアゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリアルオキシ（式中、ヘテロアリアルは、ピリジル、チオフェニルまたはチアゾリルである）を表し、ここで、アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲンからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、フェニル、フェノキシおよびヘテロアリアル基は、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_3$ アルキル（これ自体は、1～3個のハロゲン原子で任意選択により置換され得る）からなる群から独立して選択される1個もしくは2個の置換基で任意選択により置換され得；nは、0、1または2である。

20

## 【0060】

さらにより好ましくは、各 $R^8$ は独立して、フルオロ、クロロ、プロモ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、フェニル、ピリジル、フェノキシまたはピリジリオキシを表し、ここで、アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲンからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、フェニルおよびピリジル基はハロゲンからなる群から独立して選択される1個もしくは2個の置換基で任意選択により置換され得；nは0、1または2である。

## 【0061】

最も好ましくは、各 $R^8$ は独立して、フルオロ、クロロ、プロモ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシを表し、ここで、アルキルおよびアルコキシ基はハロゲンからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得；nは0または1、最も好ましくは0である。

30

## 【0062】

好ましくは、 $R^a$ は水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

## 【0063】

最も好ましくは、 $R^a$ は水素または $C_1 \sim C_2$ アルキルである。

## 【0064】

本発明に係る実施形態は以下に規定されているとおり提供される。

## 【0065】

実施形態1は、上記に定義されているとおり、式Iの化合物、および、その塩もしくはN-オキシドを提供する。

40

## 【0066】

実施形態2は実施形態1に記載の化合物を提供するものであり、式中、 $A_1$ 、 $A_2$ および $A_3$ の1つ以上は $CR^7$ を表す。

## 【0067】

実施形態3は実施形態1または2に記載の化合物を提供するものであり、式中、各 $R^7$ は独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルまたはヒドロキシルを表す。

## 【0068】

50

実施形態 4 は実施形態 1、2 または 3 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、Y - X は G 1、G 2 または G 4 である。

【0069】

実施形態 5 は実施形態 1、2、3 または 4 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は各々、水素、シアノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシおよび C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得；または、R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル基を表す。

【0070】

実施形態 6 は実施形態 1、2、3、4 または 5 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> は各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシから独立して選択され、ここで、アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシおよび C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得；または、R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、C = O または C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキル（これは、ハロゲンから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得る）を表す。

【0071】

実施形態 7 は実施形態 1、2、3、4、5 または 6 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、R<sup>5</sup> は、水素、ハロゲンまたは C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルである。

【0072】

実施形態 8 は実施形態 1、2、3、4、5、6 または 7 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、R<sup>6</sup> は、水素、ハロゲンまたは C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルである。

【0073】

実施形態 9 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7 または 8 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各 R<sup>8</sup> は独立して、ヒドロキシル、ハロゲン、シアノ、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニルオキシ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニルオキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルチオ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、フェニル、ヘテロアリール（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリーロキシ（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）を表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ基は、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシ、ヒドロキシルからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、フェニル、フェノキシおよびヘテロアリール基は、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル（これ自体は、1 ~ 3 個のハロゲン原子で任意選択により置換され得る）または C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 5 個の置換基で任意選択により置換され得；n は、0、1、2、または 3 である。

【0074】

実施形態 10 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8 または 9 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、Y - X が G 2 である場合、R<sup>a</sup> は水素または C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルである。

【0075】

実施形態 11 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9 または 10 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、A<sub>1</sub>、A<sub>2</sub> および A<sub>3</sub> の 2 つ以上は C R<sup>7</sup> を表す。

【0076】

実施形態 12 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10 または 11 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各 R<sup>7</sup> は独立して、水素、ハロゲ

10

20

30

40

50

ン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはヒドロキシルを表す。

【0077】

実施形態13は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11または12のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $Y-X$ はG1またはG2である。

【0078】

実施形態14は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12または13のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $R^1$ および $R^2$ は各々、 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され、ここで、アルキル基は、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択される1~3個の置換基で任意選択により置換され得；または、 $R^1$ および $R^2$ は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基を表す。

10

【0079】

実施形態15は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13または14のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $R^3$ および $R^4$ は各々、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され；または、 $R^3$ および $R^4$ は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ もしくはシクロプロピルを表す。

【0080】

実施形態16は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14または15のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $R^5$ は水素またはハロゲンである。

20

【0081】

実施形態17は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15または16のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $R^6$ は水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0082】

実施形態18は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16または17のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各 $R^8$ は独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、フェニル、ヘテロアリール（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニルまたはチアゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリーロキシ（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニルまたはチアゾリルである）を表し、ここで、アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲンからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、フェニル、フェノキシおよびヘテロアリール基は、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_3$ アルキル（これ自体は、1~3個のハロゲン原子で任意選択により置換され得る）からなる群から独立して選択される1個もしくは2個の置換基で任意選択により置換され得； $n$ は、0、1または2である。

30

【0083】

実施形態19は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17または18のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $Y-X$ がG2である場合、 $R^a$ は水素または $C_1 \sim C_2$ アルキルである。

40

【0084】

実施形態20は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18または19のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、A1は窒素原子であり、および、A2およびA3は共に $CR^7$ を表し、または、A2は窒素原子であり、および、A1およびA3は共に $CR^7$ を表す。

【0085】

実施形態21は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19または20のいずれか1つに記載の化合物を提

50

供するものであり、式中、各  $R^7$  は独立して、水素またはハロゲンを表す。

【0086】

実施形態 22 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20 または 21 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $R^1$  および  $R^2$  は各々  $C_1 \sim C_6$  アルキルから独立して選択され；または、 $R^1$  および  $R^2$  は、これらが結合している炭素原子と一緒に、シクロプロピル基を表す。

【0087】

実施形態 23 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21 または 22 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $R^3$  および  $R^4$  は各々、水素、フルオロまたはメチルから独立して選択され；または、 $R^3$  および  $R^4$  は、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C=O$  を表す。

10

【0088】

実施形態 24 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22 または 23 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $R^5$  は、水素、クロロまたはフルオロである。

【0089】

実施形態 25 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23 または 24 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $R^6$  は水素またはメチルである。

20

【0090】

実施形態 26 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24 または 25 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各  $R^8$  は独立して、フルオロ、クロロ、プロモ、 $C_1 \sim C_3$  アルキル、 $C_1 \sim C_3$  アルコキシ、フェニル、ピリジル、フェノキシまたはピリジルオキシを表し、ここで、アルキルおよびアルコキシ基はハロゲンからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、フェニルおよびピリジル基はハロゲンからなる群から独立して選択される 1 個もしくは 2 個の置換基で任意選択により置換され得； $n$  は 0、1 または 2 である。

30

【0091】

実施形態 27 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25 または 26 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $A_1$ 、 $A_2$  および  $A_3$  はすべては  $C R^7$  を表す。

【0092】

実施形態 28 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26 または 27 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各  $R^7$  は独立して、水素、フルオロまたはクロロを表し、ここで、2 つ以上の  $R^7$  基がフルオロまたはクロロであることはない。

40

【0093】

実施形態 29 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、11、12、13、14、15、16、17、18、20、21、22、23、24、25、26、27 または 28 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $Y-X$  は G1 である。

【0094】

実施形態 30 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、11、12、13、14、15、16、17、18、20、21、22、23、24、25、26、27、28 または 29 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $R^1$  および  $R^2$  は

50

各々、 $C_1 \sim C_2$ アルキルから独立して選択される。

【0095】

実施形態31は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、11、12、13、14、15、16、17、18、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29または30のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $R^3$ および $R^4$ は各々、水素、フルオロまたはメチルから独立して選択される。

【0096】

実施形態32は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、11、12、13、14、15、16、17、18、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30または31のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $R^5$ は水素である。

10

【0097】

実施形態33は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、11、12、13、14、15、16、17、18、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31または32のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $R^6$ は水素である。

【0098】

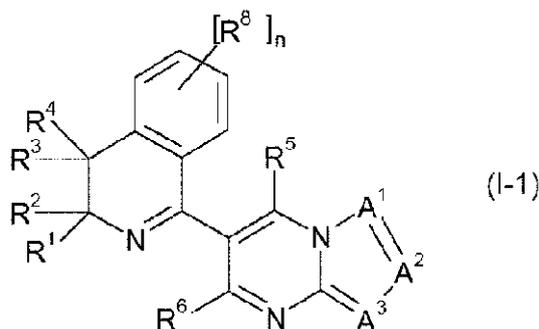
実施形態34は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、11、12、13、14、15、16、17、18、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32または33のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各 $R^8$ は独立して、フルオロ、クロロ、ブロモ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシを表し、ここで、アルキルおよびアルコキシ基はハロゲンからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で任意選択により置換され得；nは0または1、最も好ましくは0である。

20

【0099】

本発明に係る化合物の好ましい群は式I-1のものであり、

【化3】



30

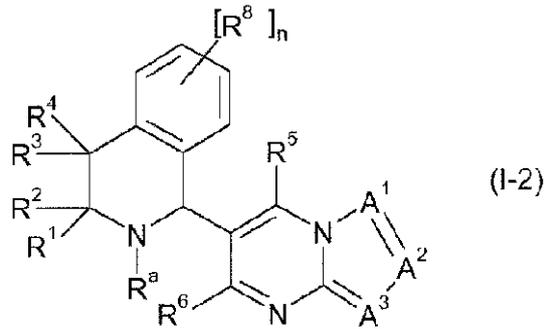
式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ およびnは、式Iの化合物、または、その塩もしくはN-オキシドに定義されているとおりである。 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ およびnの好ましい定義は、式Iの化合物に定義されているとおりである。

40

【0100】

他の本発明に係る化合物の好ましい群は式I-2のものであり、

## 【化4】



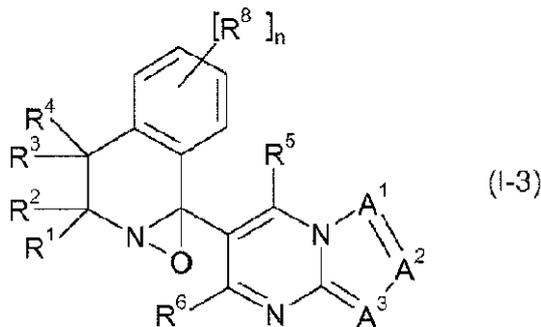
10

式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $R^a$ および $n$ は、式 I の化合物、または、その塩もしくは N - オキシドに定義されているとおりである。 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $R^a$ および $n$ の好ましい定義は、式 I の化合物に定義されているとおりである。

## 【0101】

他の本発明に係る化合物の好ましい群は式 I - 3 のものであり、

## 【化5】



20

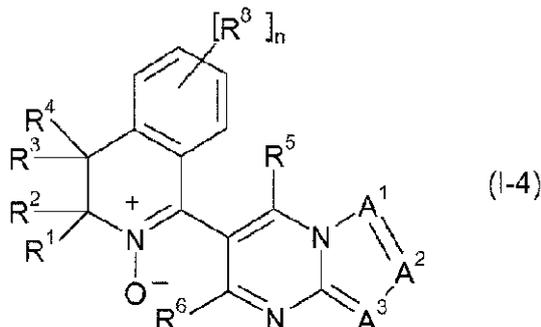
式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $n$ は、式 I の化合物、または、その塩もしくは N - オキシドに定義されているとおりである。 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $n$ の好ましい定義は、式 I の化合物に定義されているとおりである。

30

## 【0102】

他の本発明に係る化合物の好ましい群は式 I - 4 のものであり、

## 【化6】



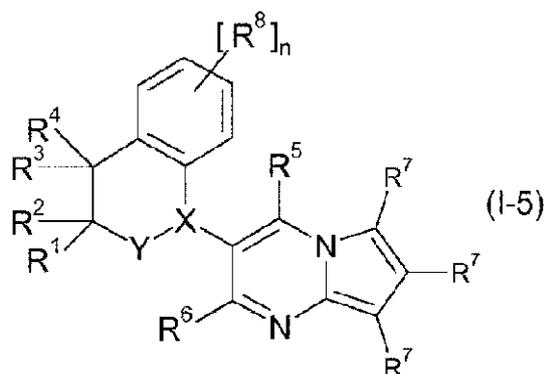
40

式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $n$ は、式 I の化合物、または、その塩もしくは N - オキシドに定義されているとおりである。 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $n$ の好ましい定義は、式 I の化合物に定義されているとおりである。

## 【0103】

50

他の本発明に係る化合物の好ましい群は式 I - 5 のものであり、  
【化 7】

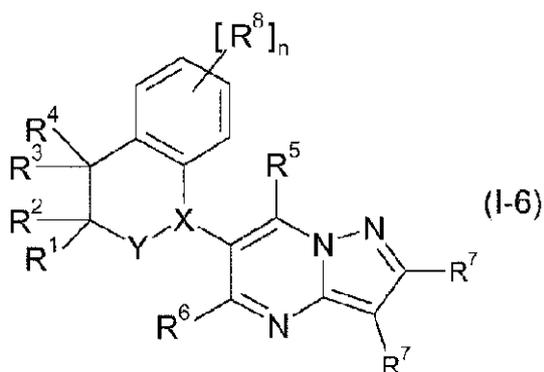


10

式中、Y - X、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>およびnは、式 I の化合物、または、その塩もしくはN - オキッドに定義されているとおりである。Y - X、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>およびnの好ましい定義は、式 I の化合物に定義されているとおりである。

【0104】

他の本発明に係る化合物の好ましい群は式 I - 6 のものであり、  
【化 8】



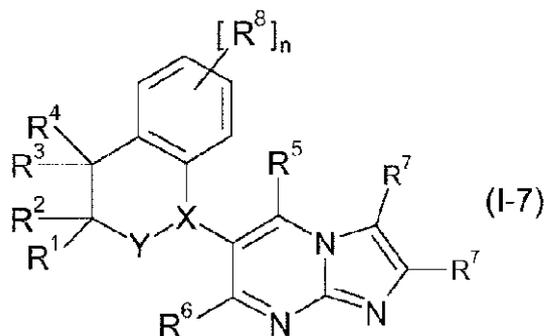
20

30

式中、Y - X、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>およびnは、式 I の化合物、または、その塩もしくはN - オキッドに定義されているとおりである。Y - X、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>およびnの好ましい定義は、式 I の化合物に定義されているとおりである。

【0105】

他の本発明に係る化合物の好ましい群は式 I - 7 のものであり、  
【化 9】



40

式中、Y - X、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>およびnは、式 I の化合物、または、その塩もしくはN - オキッドに定義されているとおりである。Y - X、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、

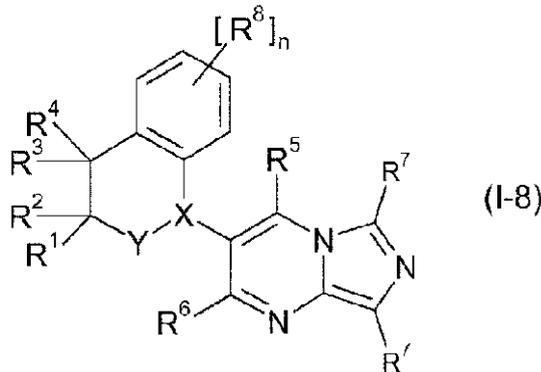
50

$R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ および $n$ の好ましい定義は、式 I の化合物に定義されているとおりである。

【0106】

本発明に係る化合物の他の好ましい群は式 I - 8 のものである。

【化10】



10

式中、 $Y - X$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ および $n$ は、式 I の化合物またはその塩もしくは N - オキドについて定義されているとおりである。 $Y - X$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ および $n$ 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。

20

【0107】

さらなる本発明に係る化合物の好ましい群は式 I - 9 のものであり、これは、 $A_1$ 、 $A_2$  および  $A_3$  の 1 つ以上が  $C R^7$  を表し；各  $R^7$  が独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$  アルキニルまたはヒドロキシルを表し； $Y - X$  が G 1、G 2 または G 4 であり； $R^1$  および  $R^2$  が各々、水素、シアノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシおよび  $C_1 \sim C_6$  アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得；または、 $R^1$  および  $R^2$  が、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル基を表し； $R^3$  および  $R^4$  が各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシから独立して選択され、ここで、アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシおよび  $C_1 \sim C_6$  アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得；または、 $R^3$  および  $R^4$  が、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C = O$  または  $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル（これは、ハロゲンから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得る）を表し； $R^5$  が、水素、ハロゲンまたは  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり； $R^6$  が、水素、ハロゲンまたは  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり；各  $R^8$  が独立して、ヒドロキシル、ハロゲン、シアノ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_3 \sim C_7$  シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$  アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$  アルキニル、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルカルボニル、フェニル、ヘテロアリール（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフエニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリールオキシ（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフエニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）を表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、ヒドロキシルからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、フェニル、フェノキシおよびヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルキル（これ自体は、1 ~ 3 個のハロゲン原子で任意選択により置換され得る）または  $C_1 \sim C_6$  アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 5 個の置換基で任意選択により置換され得； $n$  が、0、1、2、または 3 であり；ならびに、 $R^8$  が水素または  $C_1 \sim C_6$  アルキルである式 I の化合物、または、その塩もしくは N - オキドである。

30

40

50

## 【0108】

さらなる本発明に係る化合物の好ましい群は式 I - 10 のものであり、これは、 $A_1$ 、 $A_2$  および  $A_3$  の 2 つ以上が  $CR^7$  を表し；各  $R^7$  が独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルキルまたはヒドロキシルを表し； $Y - X$  が  $G_1$  または  $G_2$  であり； $R^1$  および  $R^2$  が各々、 $C_1 \sim C_6$  アルキルから独立して選択され、ここで、アルキル基はハロゲンおよび  $C_1 \sim C_6$  アルコキシから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得；または、 $R^1$  および  $R^2$  が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル基を表し； $R^3$  および  $R^4$  が各々、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルキルから独立して選択され；または、 $R^3$  および  $R^4$  が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C = O$  またはシクロプロピルを表し； $R^5$  が水素またはハロゲンであり； $R^6$  が水素または  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり；各  $R^8$  が独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、フェニル、ヘテロアリール（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニルまたはチアゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリーロキシ（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニルまたはチアゾリルである）を表し、ここで、アルキルおよびアルコキシ基はハロゲンからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、フェニル、フェノキシおよびヘテロアリール基は、ハロゲンまたは  $C_1 \sim C_3$  アルキル（これ自体は、1 ~ 3 個のハロゲン原子で任意選択により置換され得る）からなる群から独立して選択される 1 個もしくは 2 個の置換基で任意選択により置換され得； $n$  が、0、1 または 2 であり；ならびに、 $R^9$  が水素または  $C_1 \sim C_2$  アルキルである、式 I の化合物、または、その塩もしくは N - オキシドである。

10

20

## 【0109】

さらなる本発明に係る化合物の好ましい群は式 I - 11 のものであり、これは、 $A_1$  が窒素原子であり、および、 $A_2$  および  $A_3$  が共に  $CR^7$  を表し、または、 $A_2$  が窒素原子であり、および、 $A_1$  および  $A_3$  が共に  $CR^7$  を表し；各  $R^7$  が独立して水素またはハロゲンを表し； $Y - X$  が  $G_1$  または  $G_2$  であり； $R^1$  および  $R^2$  が各々  $C_1 \sim C_6$  アルキルから独立して選択され；または、 $R^1$  および  $R^2$  が、これらが結合している炭素原子と一緒にあってシクロプロピル基を表し； $R^3$  および  $R^4$  が各々、水素、フルオロまたはメチルから独立して選択され；または、 $R^3$  および  $R^4$  が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって  $C = O$  を表し； $R^5$  が、水素、クロロまたはフルオロであり； $R^6$  が水素またはメチルであり；各  $R^8$  が独立して、フルオロ、クロロ、プロモ、 $C_1 \sim C_3$  アルキル、 $C_1 \sim C_3$  アルコキシ、フェニル、ピリジル、フェノキシまたはピリジロキシを表し、ここで、アルキルおよびアルコキシ基はハロゲンからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、フェニルおよびピリジル基はハロゲンからなる群から独立して選択される 1 個もしくは 2 個の置換基で任意選択により置換され得； $n$  が 0、1 または 2 であり；ならびに、 $R^9$  が水素または  $C_1 \sim C_2$  アルキルである式 I の化合物、または、その塩もしくは N - オキシドである。

30

## 【0110】

さらなる本発明に係る化合物の好ましい群は式 I - 11 のものであり、これは、 $A_1$ 、 $A_2$  および  $A_3$  がすべて  $CR^7$  を表し；各  $R^7$  が独立して、水素、フルオロまたはクロロを表し、ここで、2 つ以上の  $R^7$  基がフルオロまたはクロロであることはなく； $Y - X$  が  $G_1$  であり； $R^1$  および  $R^2$  が各々  $C_1 \sim C_2$  アルキルから独立して選択され； $R^3$  および  $R^4$  が各々、水素、フルオロまたはメチルから独立して選択され； $R^5$  が水素であり； $R^6$  が水素であり；各  $R^8$  が独立して、フルオロ、クロロ、プロモ、 $C_1 \sim C_3$  アルキル、 $C_1 \sim C_3$  アルコキシを表し、ここで、アルキルおよびアルコキシ基はハロゲンからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得； $n$  が 0 または 1、最も好ましくは 0 である式 I の化合物、または、その塩もしくは N - オキシドである。

40

## 【0111】

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、または、農芸化学活性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、

50

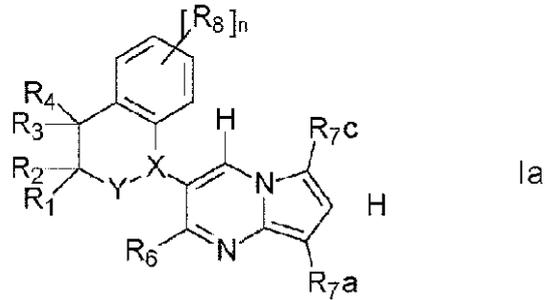
向上した物理化学的特性または高い生分解性)を含む、多数の有益性を有し得る。

【0112】

式Iの化合物の特定の例が、以下の表A1～A27、B1～B12、C1～C12およびD1～D5に例示されている。

表A1は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、

【化11】



10

式中、R<sub>6</sub>、R<sub>7a</sub>およびR<sub>7c</sub>はすべてHであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub>および基Y-Xの値は、以下の表Zに定義されているとおりである。

【0113】

【表1】

表Z

項目	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	R <sub>8</sub>	Y-X	Ra
1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H [n=0]	G1	-
2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-F	G1	-
3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	6-F	G1	-
4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	7-F	G1	-
5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	8-F	G1	-
6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-Cl	G1	-
7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	6-Cl	G1	-
8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	7-Cl	G1	-
9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	8-Cl	G1	-
10	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-Br	G1	-
11	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	6-Br	G1	-
12	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	7-Br	G1	-
13	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	8-Br	G1	-
14	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-I	G1	-
15	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5, 6-F <sub>2</sub>	G1	-
16	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5, 6-Cl <sub>2</sub>	G1	-
17	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-F-6-Cl	G1	-
18	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-CH <sub>3</sub>	G1	-
19	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	6-CH <sub>3</sub>	G1	-
20	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	7-CH <sub>3</sub>	G1	-
21	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	8-CH <sub>3</sub>	G1	-
22	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	G1	-
23	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-C≡CH	G1	-
24	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-C(H)=CH <sub>2</sub>	G1	-
25	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-シクロプロピル	G1	-
26	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-CN	G1	-
27	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-OH	G1	-
28	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-OCH <sub>3</sub>	G1	-
29	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	G1	-
30	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-O-(ピリド-2-イル)	G1	-
31	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	G1	-
32	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-OCHF <sub>2</sub>	G1	-
33	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-OCF <sub>3</sub>	G1	-
34	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-OCH <sub>2</sub> C(H)=CH <sub>2</sub>	G1	-

10

20

30

40

35	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-OCH <sub>2</sub> C≡CH	G1	-
36	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-CF <sub>3</sub>	G1	-
37	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-CHF <sub>2</sub>	G1	-
38	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-C <sub>6</sub> H <sub>6</sub>	G1	-
39	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-(2-F-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )	G1	-
40	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-(チエン-2-イル)	G1	-
41	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-(チアゾール-2-イル)	G1	-
42	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-NH <sub>2</sub>	G1	-
43	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-NHC(O)CH <sub>3</sub>	G1	-
44	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-C(O)H	G1	-
45	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-C(O)OH	G1	-
46	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-C(O)NH <sub>2</sub>	G1	-
47	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-C(O)N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	G1	-
48	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-COCH <sub>3</sub>	G1	-
49	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H [n=0]	G2	H
50	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-F	G2	H
51	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-Cl	G2	H
52	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-CH <sub>3</sub>	G2	H
53	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H [n=0]	G2	CH <sub>3</sub>
54	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-F	G2	CH <sub>3</sub>
55	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-Cl	G2	CH <sub>3</sub>
56	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-CH <sub>3</sub>	G2	CH <sub>3</sub>
57	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H [n=0]	G3	-
58	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-F	G3	-
59	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-Cl	G3	-
60	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-CH <sub>3</sub>	G3	-
61	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H [n=0]	G4	-
62	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-F	G4	-
63	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-Cl	G4	-
64	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	5-CH <sub>3</sub>	G4	-
65	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H [n=0]	G1	-
66	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	5-F	G1	-
67	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	6-F	G1	-
68	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	5-Cl	G1	-
69	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	6-Cl	G1	-

10

20

30

40

70	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	5-Br	G1	-
71	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	G1	-
72	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	5-OCH <sub>3</sub>	G1	-
73	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	5-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	G1	-
74	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OH	H [n=0]	G1	-
75	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OH	5-F	G1	-
76	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OH	6-F	G1	-
77	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OH	5-Cl	G1	-
78	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OH	6-Cl	G1	-
79	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OH	5-Br	G1	-
80	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OH	5-CH <sub>3</sub>	G1	-
81	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OH	5-OCH <sub>3</sub>	G1	-
82	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OH	5-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	G1	-
83	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	H [n=0]	G1	-
84	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	5-F	G1	-
85	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	6-F	G1	-
86	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	5-Cl	G1	-
87	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	6-Cl	G1	-
88	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	5-Br	G1	-
89	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	G1	-
90	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	5-OCH <sub>3</sub>	G1	-
91	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	5-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	G1	-
92	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	F	H [n=0]	G1	-
93	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	F	5-F	G1	-
94	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	F	6-F	G1	-
95	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	F	5-Cl	G1	-
96	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	F	6-Cl	G1	-
97	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	F	5-Br	G1	-
98	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	F	5-CH <sub>3</sub>	G1	-
99	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	F	5-OCH <sub>3</sub>	G1	-
100	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	F	5-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	G1	-
101	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H [n=0]	G1	-
102	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	G1	-
103	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	6-F	G1	-
104	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-Cl	G1	-
105	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	6-Cl	G1	-
106	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-Br	G1	-

10

20

30

40

107	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5, 6-F <sub>2</sub>	G1	-
108	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5, 6-Cl <sub>2</sub>	G1	-
109	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F-6-Cl	G1	-
110	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	G1	-
111	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	G1	-
112	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-C(O)H	G1	-
113	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-CN	G1	-
114	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-OH	G1	-
115	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-OCH <sub>3</sub>	G1	-
116	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	G1	-
117	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-O-(ピリド-2-イル)	G1	-
118	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	G1	-
119	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-C <sub>6</sub> H <sub>6</sub>	G1	-
120	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-(2-F-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )	G1	-
121	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-(チエン-2-イル)	G1	-
122	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-(チアゾール-2-イル)	G1	-
123	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-OCHF <sub>2</sub>	G1	-
124	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-OCF <sub>3</sub>	G1	-
125	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-OCH <sub>2</sub> C(H)=CH <sub>2</sub>	G1	-
126	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-OCH <sub>2</sub> C≡CH	G1	-
127	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub>	G1	-
128	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-CHF <sub>2</sub>	G1	-
129	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H [n=0]	G2	H
130	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	G2	H
131	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H [n=0]	G2	CH <sub>3</sub>
132	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	G2	CH <sub>3</sub>
133	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H [n=0]	G3	-
134	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	G3	-
135	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H [n=0]	G3	-
136	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	G3	-
137	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H [n=0]	G4	-
138	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	G4	-
139	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H [n=0]	G4	-
140	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	G4	-

10

20

30

40

141	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	=0		H [n=0]	G1	-
142	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	=0		5-F	G1	-
143	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	=0		6-F	G1	-
144	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	=0		5-Cl	G1	-
145	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	=0		6-Cl	G1	-
146	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	=0		5-Br	G1	-
147	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	=0		5-CH <sub>3</sub>	G1	-
148	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	=0		5-OCH <sub>3</sub>	G1	-
149	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	=0		5-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	G1	-
150	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	F	H [n=0]	G1	-
151	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	F	5-F	G1	-
152	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	F	6-F	G1	-
153	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	F	5-Cl	G1	-
154	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	F	6-Cl	G1	-
155	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	F	5-Br	G1	-
156	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	F	5-CH <sub>3</sub>	G1	-
157	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	F	5-OCH <sub>3</sub>	G1	-
158	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	F	5-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	G1	-
159	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	シクロプロピル		H [n=0]	G1	-
160	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	シクロプロピル		5-F	G1	-
161	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	シクロブチル		H [n=0]	G1	-
162	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	シクロブチル		5-F	G1	-
163	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	シクロペンチル		H [n=0]	G1	-
164	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	シクロペンチル		5-F	G1	-
165	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	シクロヘキシル		H [n=0]	G1	-
166	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	シクロヘキシル		5-F	G1	-
167	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	H [n=0]	G1	-
168	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	5-F	G1	-
169	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	5-Cl	G1	-
170	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	5-CH <sub>3</sub>	G1	-
171	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	5-OCH <sub>3</sub>	G1	-
172	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	H [n=0]	G1	-
173	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	5-F	G1	-
174	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	5-Cl	G1	-
175	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	H [n=0]	G1	-
176	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	5-F	G1	-

10

20

30

40

177	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	H	5-Cl	G1	-
178	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H [n=0]	G1	-
179	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	5-F	G1	-
180	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	5-Cl	G1	-
181	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H [n=0]	G1	-
182	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	G1	-
183	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-Cl	G1	-
184	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	H [n=0]	G1	-
185	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	5-F	G1	-
186	CH <sub>4</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	5-Cl	G1	-
187	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H [n=0]	G1	-
188	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	G1	-
189	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-Cl	G1	-
190	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H [n=0]	G1	-
191	CH <sub>3</sub>	H	H	H	5-F	G1	-
192	CH <sub>3</sub>	H	H	H	5-CH <sub>3</sub>	G1	-
193	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	H [n=0]	G1	-
194	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	5-F	G1	-
195	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	5-Cl	G1	-
196	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	H [n=0]	G1	-
197	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	5-F	G1	-
198	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	5-Cl	G1	-
199	シクロプロピル		H	H	H [n=0]	G1	-
200	シクロプロピル		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H [n=0]	G1	-
201	シクロプロピル		= 0		H [n=0]	G1	-
202	シクロプロピル		F	F	H [n=0]	G1	-
203	シクロプロピル		シクロプロピル		H [n=0]	G1	-
204	シクロプロピル		H	H	5-F	G1	-
205	シクロプロピル		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	G1	-
206	シクロプロピル		= 0		5-F	G1	-
207	シクロプロピル		F	F	5-F	G1	-
208	シクロプロピル		シクロプロピル		5-F	G1	-
209	シクロブチル		H	H	H [n=0]	G1	-
210	シクロブチル		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H [n=0]	G1	-
211	シクロブチル		= 0		H [n=0]	G1	-
212	シクロブチル		F	F	H [n=0]	G1	-
213	シクロブチル		H	H	5-F	G1	-

10

20

30

40

214	シクロブチル	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	G1	-
215	シクロブチル	= 0		5-F	G1	-
216	シクロブチル	F	F	5-F	G1	-
217	シクロペンチル	H	H	H [n=0]	G1	-
218	シクロペンチル	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H [n=0]	G1	-
219	シクロペンチル	= 0		H [n=0]	G1	-
220	シクロペンチル	F	F	H [n=0]	G1	-
221	シクロペンチル	H	H	5-F	G1	-
222	シクロペンチル	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	G1	-
223	シクロペンチル	= 0		5-F	G1	-
224	シクロペンチル	F	F	5-F	G1	-
225	シクロヘキシル	H	H	H [n=0]	G1	-
226	シクロヘキシル	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H [n=0]	G1	-
227	シクロヘキシル	= 0		H [n=0]	G1	-
228	シクロヘキシル	F	F	H [n=0]	G1	-
229	シクロヘキシル	H	H	5-F	G1	-
230	シクロヘキシル	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	5-F	G1	-
231	シクロヘキシル	= 0		5-F	G1	-
232	シクロヘキシル	F	F	5-F	G1	-

10

20

## 【 0 1 1 4 】

表 A 2 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R<sub>7a</sub>、R<sub>7c</sub> は H であり、R<sub>6</sub> はメチルであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub> および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 1 5 】

表 A 3 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R<sub>7a</sub>、R<sub>7c</sub> は H であり、R<sub>6</sub> はフルオロであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub> および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

30

## 【 0 1 1 6 】

表 A 4 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R<sub>7a</sub>、R<sub>7c</sub> は H であり、R<sub>6</sub> はクロロであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub> および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 1 7 】

表 A 5 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R<sub>7a</sub>、R<sub>7c</sub> は H であり、R<sub>6</sub> はメトキシであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub> および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 1 8 】

表 A 6 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R<sub>6</sub>、R<sub>7a</sub> は H であり、R<sub>7c</sub> はフルオロであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub> および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

40

## 【 0 1 1 9 】

表 A 7 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R<sub>6</sub>、R<sub>7a</sub> は H であり、R<sub>7c</sub> はヒドロキシルであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub> および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 2 0 】

表 A 8 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R<sub>6</sub>、R<sub>7a</sub> は H であり、R<sub>7c</sub> はクロロであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub> および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

50

## 【 0 1 2 1 】

表 A 9 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、 $R_6$ 、 $R_7a$  は H であり、 $R_7c$  はメチルであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 2 2 】

表 A 10 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、 $R_6$ 、 $R_7c$  は H であり、 $R_7a$  はフルオロであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 2 3 】

表 A 11 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、 $R_6$ 、 $R_7c$  は H であり、 $R_7a$  はメチルであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

10

## 【 0 1 2 4 】

表 A 12 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、 $R_6$ 、 $R_7c$  は H であり、 $R_7a$  はクロロであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 2 5 】

表 A 13 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、 $R_6$ 、 $R_7c$  は H であり、 $R_7a$  はブromoであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

20

## 【 0 1 2 6 】

表 A 14 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、 $R_6$ 、 $R_7c$  は H であり、 $R_7a$  はシアノであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 2 7 】

表 A 15 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、 $R_6$ 、 $R_7c$  は H であり、 $R_7a$  はヒドロキシルであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 2 8 】

表 A 16 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、 $R_6$ 、 $R_7c$  は H であり、 $R_7a$  はメトキシであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

30

## 【 0 1 2 9 】

表 A 17 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、 $R_6$ 、 $R_7c$  は H であり、 $R_7a$  はジフルオロメチルであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 3 0 】

表 A 18 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、 $R_6$ 、 $R_7c$  は H であり、 $R_7a$  はエチニルであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

40

## 【 0 1 3 1 】

表 A 19 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、 $R_6$ 、 $R_7c$  は H であり、 $R_7a$  はトリフルオロメチルであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 3 2 】

表 A 20 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、 $R_6$ 、 $R_7c$  は H であり、 $R_7a$  はシクロプロピルであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 3 3 】

表 A 21 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、 $R_6$  は H であり、

50

R<sub>7c</sub>はフルオロであり、R<sub>7a</sub>はフルオロであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub>および基Y - Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0134】

表A22は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、R<sub>6</sub>はHであり、R<sub>7c</sub>はヒドロキシルであり、R<sub>7a</sub>はフルオロであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub>および基Y - Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0135】

表A23は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、R<sub>6</sub>はHであり、R<sub>7c</sub>はメチルであり、R<sub>7a</sub>はフルオロであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub>および基Y - Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

10

【0136】

表A24は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、R<sub>6</sub>はすべてHであり、R<sub>7c</sub>はプロモであり、R<sub>7a</sub>はフルオロであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub>および基Y - Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0137】

表A25は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、R<sub>6</sub>はすべてHであり、R<sub>7c</sub>はクロロであり、R<sub>7a</sub>はフルオロであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub>および基Y - Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0138】

表A26は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、R<sub>6</sub>はメトキシであり、R<sub>7c</sub>はHであり、R<sub>7a</sub>はフルオロであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub>および基Y - Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

20

【0139】

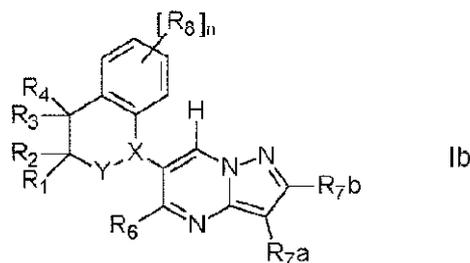
表A27は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、R<sub>6</sub>はメチルであり、R<sub>7c</sub>はHであり、R<sub>7a</sub>はフルオロであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub>および基Y - Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0140】

表B1は232種の式Ibの化合物を開示するものであり、

【化12】

30



式中、R<sub>6</sub>、R<sub>7a</sub>およびR<sub>7b</sub>はHであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub>および基Y - Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0141】

表B2は232種の式Ibの化合物を提供するものであり、式中、R<sub>7a</sub>、R<sub>7b</sub>はHであり、R<sub>6</sub>はメチルであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub>および基Y - Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

40

【0142】

表B3は232種の式Ibの化合物を提供するものであり、式中、R<sub>7a</sub>、R<sub>7b</sub>はHであり、R<sub>6</sub>はフルオロであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub>および基Y - Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0143】

表B4は232種の式Ibの化合物を提供するものであり、式中、R<sub>7a</sub>、R<sub>7b</sub>はHであり、R<sub>6</sub>はクロロであり、また、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>8</sub>および基Y - Xの値は

50

上記の表 Z に定義されているとおりである。

【 0 1 4 4 】

表 B 5 は 2 3 2 種の式 I b の化合物を提供するものであり、式中、 $R_{7a}$ 、 $R_{7b}$  は H であり、 $R_6$  はメトキシであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【 0 1 4 5 】

表 B 6 は 2 3 2 種の式 I b の化合物を提供するものであり、式中、 $R_6$ 、 $R_{7b}$  は H であり、 $R_{7a}$  はフルオロであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【 0 1 4 6 】

表 B 7 は 2 3 2 種の式 I b の化合物を提供するものであり、式中、 $R_6$ 、 $R_{7b}$  は H であり、 $R_{7a}$  はメチルであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【 0 1 4 7 】

表 B 8 は 2 3 2 種の式 I b の化合物を提供するものであり、式中、 $R_6$ 、 $R_{7b}$  は H であり、 $R_{7a}$  はメトキシであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【 0 1 4 8 】

表 B 9 は 2 3 2 種の式 I b の化合物を提供するものであり、式中、 $R_6$ 、 $R_{7b}$  は H であり、 $R_{7a}$  はクロロであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【 0 1 4 9 】

表 B 10 は 2 3 2 種の式 I b の化合物を提供しており、式中、 $R_6$  はメチルであり、 $R_{7b}$  は H であり、 $R_{7a}$  はフルオロであり、ならびに、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z において定義されているとおりである。

【 0 1 5 0 】

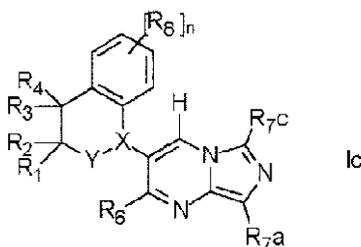
表 B 11 は 2 3 2 種の式 I b の化合物を提供しており、式中、 $R_6$  は H であり、 $R_{7b}$  はメチルであり、 $R_{7a}$  は H であり、ならびに、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z において定義されているとおりである。

【 0 1 5 1 】

表 B 12 は 2 3 2 種の式 I b の化合物を提供しており、式中、 $R_6$  は H であり、 $R_{7b}$  はメチルであり、 $R_{7a}$  はフルオロであり、ならびに、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z において定義されているとおりである。

【 0 1 5 2 】

表 C 1 は 2 3 2 種の式 I c の化合物を開示するものであり、  
【化 1 3】



式中、 $R_6$ 、 $R_{7a}$ 、 $R_{7c}$  はすべて H であり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【 0 1 5 3 】

表 C 2 は 2 3 2 種の式 I c の化合物を提供するものであり、式中、 $R_{7a}$ 、 $R_{7c}$  は H であり、 $R_6$  はメチルであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 5 4 】

表 C 3 は 2 3 2 種の式 I c の化合物を提供するものであり、式中、 $R_{7a}$ 、 $R_{7c}$  は H であり、 $R_6$  はフルオロであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 5 5 】

表 C 4 は 2 3 2 種の式 I c の化合物を提供するものであり、式中、 $R_{7a}$ 、 $R_{7c}$  は H であり、 $R_6$  はクロロであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 5 6 】

表 C 5 は 2 3 2 種の式 I c の化合物を提供するものであり、式中、 $R_{7a}$ 、 $R_{7c}$  は H であり、 $R_6$  はメトキシであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 5 7 】

表 C 6 は 2 3 2 種の式 I c の化合物を提供するものであり、式中、 $R_{7a}$ 、 $R_6$  は H であり、 $R_{7c}$  はメチルであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 5 8 】

表 C 7 は 2 3 2 種の式 I c の化合物を提供するものであり、式中、 $R_{7a}$ 、 $R_6$  は H であり、 $R_{7c}$  はヒドロキシルであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 5 9 】

表 C 8 は 2 3 2 種の式 I c の化合物を提供するものであり、式中、 $R_{7c}$ 、 $R_6$  は H であり、 $R_{7a}$  はフルオロであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 6 0 】

表 C 9 は 2 3 2 種の式 I c の化合物を提供するものであり、式中、 $R_{7c}$ 、 $R_6$  は H であり、 $R_{7a}$  はメチルであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 6 1 】

表 C 1 0 は 2 3 2 種の式 I c の化合物を提供するものであり、式中、 $R_{7c}$ 、 $R_6$  は H であり、 $R_{7a}$  はメトキシであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 6 2 】

表 C 1 1 は 2 3 2 種の式 I c の化合物を提供するものであり、式中、 $R_{7c}$ 、 $R_6$  は H であり、 $R_{7a}$  はクロロであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 6 3 】

表 C 1 2 は 2 3 2 種の式 I c の化合物を提供するものであり、式中、 $R_{7c}$  は H であり、 $R_6$  はメチルであり、 $R_{7a}$  はフルオロであり、また、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$  および基 Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

## 【 0 1 6 4 】

表 D 1 は 2 3 2 種の式 I d の化合物を開示しており、

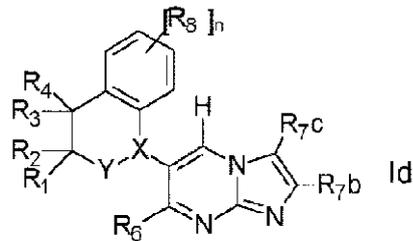
10

20

30

40

## 【化14】



式中、 $R_6$ 、 $R_{7b}$ 、 $R_{7c}$ はすべてHであり、  
 ならびに、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$ および基Y - Xの値は上記の表Zにおいて定義されているとおりである。

10

## 【0165】

表D2は232種の式Idの化合物を提供しており、式中、 $R_6$ はメチルであり、 $R_{7b}$ 、 $R_{7c}$ はHであり、ならびに、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$ および基Y - Xの値は上記の表Zにおいて定義されているとおりである。

## 【0166】

表D3は232種の式Idの化合物を提供しており、式中、 $R_6$ 、 $R_{7b}$ はHであり、 $R_{7c}$ はヒドロキシルであり、ならびに、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$ および基Y - Xの値は上記の表Zにおいて定義されているとおりである。

20

## 【0167】

表D4は232種の式Idの化合物を提供しており、式中、 $R_6$ 、 $R_{7b}$ はHであり、 $R_{7c}$ はメチルであり、ならびに、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$ および基Y - Xの値は上記の表Zにおいて定義されているとおりである。

## 【0168】

表D5は232種の式Idの化合物を提供しており、式中、 $R_6$ 、 $R_{7c}$ はHであり、 $R_{7b}$ はメチルであり、ならびに、式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_8$ および基Y - Xの値は上記の表Zにおいて定義されているとおりである。

## 【0169】

本発明の化合物は以下のスキームに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、各可変項の定義は、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

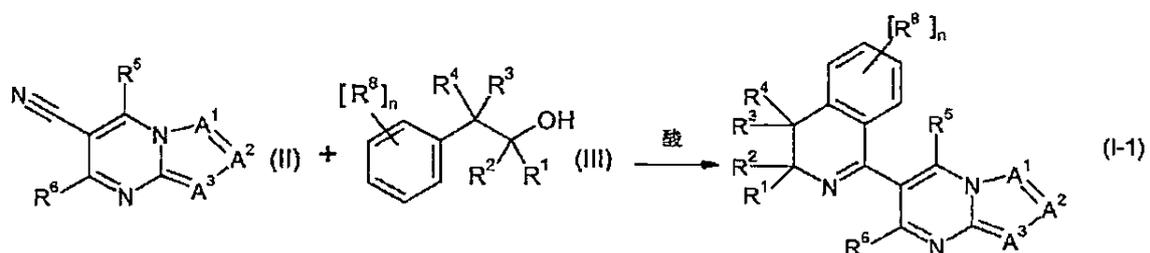
## 【0170】

式I-1の化合物(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ およびnは式Iに定義されているとおりである)は、式IIの化合物(式中、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ および $A^3$ は式Iに定義されているとおりである)の式IIIの化合物(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^8$ およびnは式Iに定義されているとおりである)を伴う酸性条件下での、例えば硫酸、トリフルオロ酢酸またはトリフルオロメタンスルホン酸を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム1に示されている。

## 【化15】

40

## スキーム1



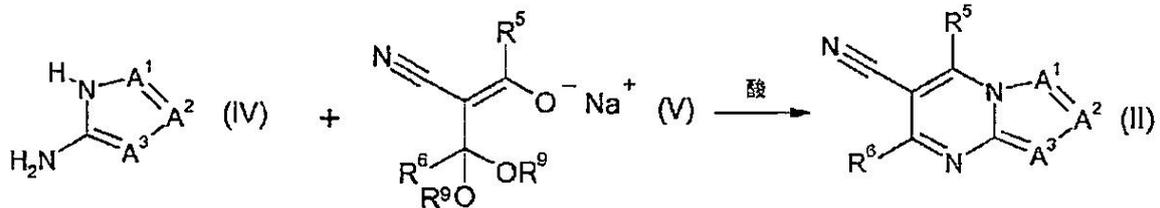
## 【0171】

50

式 I I の化合物（式中、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ および $A^3$ 、は式 I に定義されているとおりである）は、式 I V の化合物（これは市販されているか、または、多様な公知の方法により容易に入手可能である）（式中、 $A^1$ 、 $A^2$ および $A^3$ は式 I に定義されているとおりである）の式 V の化合物（式中、 $R^5$ および $R^6$ は式 I に定義されているとおりであり、および、 $R^9$ は $C_1 \sim C_6$ アルキルである）を伴う酸条件下での、例えば塩酸を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム 2 に示されている。

【化 16】

スキーム 2



10

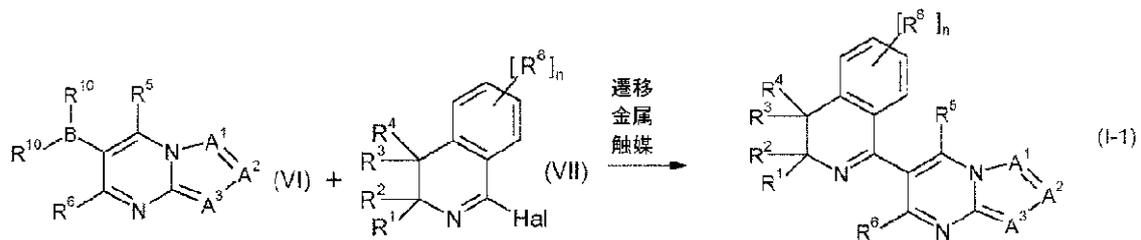
【0172】

あるいは、式 I - 1 の化合物（式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $n$ は式 I に定義されているとおりである）は、式 V I の化合物（式中、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ および $A^3$ は式 I に定義されているとおりであり、ならびに、 $R^{10}$ はヒドロキシルであるか、または、2つの $R^{10}$ は間に介在するホウ素原子と一緒になって5員または6員飽和複素環を形成する）の式 V I I の化合物（式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^8$ および $n$ は式 I に定義されているとおりであり、ならびに、 $Hal$ はハロゲン、好ましくはクロロもしくはプロモである）を伴う、鈴木 - 宮浦反応の条件下における変換により得ることが可能である。これはスキーム 3 に示されている。

20

【化 17】

スキーム 3



30

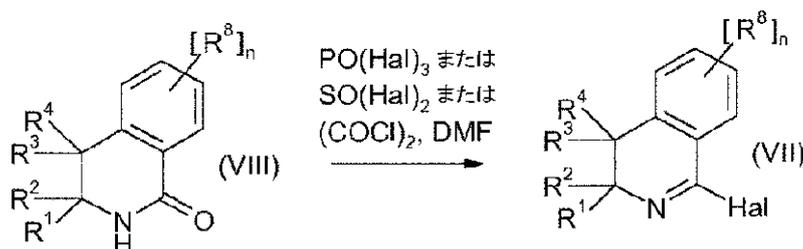
【0173】

式 V I I の化合物（式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^8$ および $n$ は式 I に定義されているとおりであり、ならびに、 $Hal$ はハロゲン、好ましくはクロロもしくはプロモである）は、式 V I I I の化合物（式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^8$ および $n$ は式 I に定義されているとおりである）の、オキシ塩化リン、オキシ臭化リン、塩化チオニル、臭化チオニルまたはヴィルスマイヤー試薬などのハロゲン化試薬を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム 4 に示されている。

40

【化 18】

スキーム 4



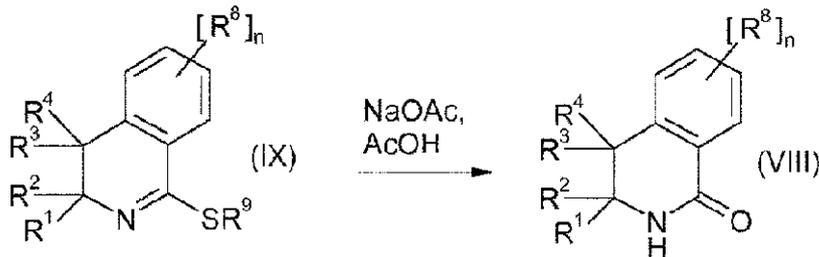
50

## 【0174】

式VIIの化合物(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^8$ および $n$ は式Iに定義されているとおりである)は、式IXの化合物(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^8$ および $n$ は式Iに定義されているとおりであり、ならびに、 $R^9$ は $C_1 \sim C_6$ アルキルである)の酢酸中の酢酸ナトリウムを伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム5に示されている。

## 【化19】

## スキーム5

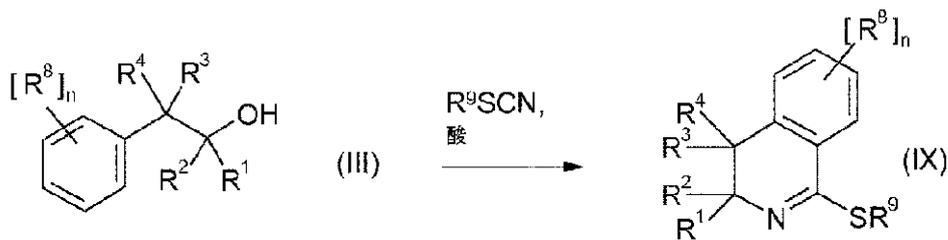


## 【0175】

式IXの化合物(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^8$ および $n$ は式Iに定義されているとおりであり、ならびに、 $R^9$ は $C_1 \sim C_6$ アルキルである)は、式IIIの化合物(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^8$ および $n$ は式Iに定義されているとおりである)の $C_1 \sim C_6$ アルキルチオシアネートを伴う酸性条件下での、例えば硫酸を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム6に示されている。

## 【化20】

## スキーム6

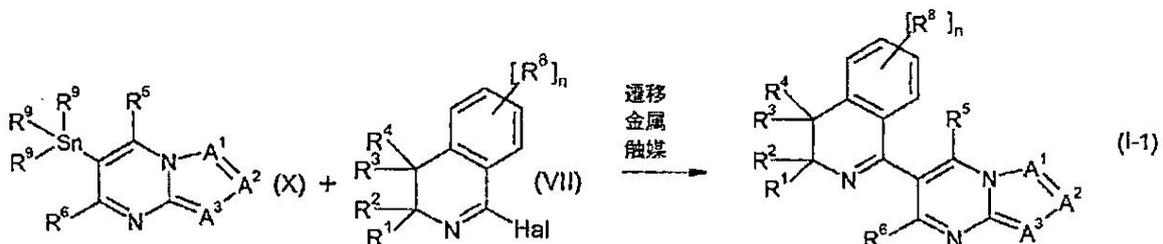


## 【0176】

あるいは、式I-1の化合物(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $n$ は式Iに定義されているとおりである)は、式Xの化合物(式中、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ および $A^3$ は式Iに定義されているとおりであり、ならびに、 $R^9$ は $C_1 \sim C_6$ アルキルである)の式VIIの化合物(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^8$ および $n$ は式Iに定義されているとおりであり、ならびに、 $Hal$ はハロゲン、好ましくはクロロもしくはプロモである)を伴う、スティール反応の条件下での変換により得ることが可能である。これはスキーム7に示されている。

## 【化21】

## スキーム7

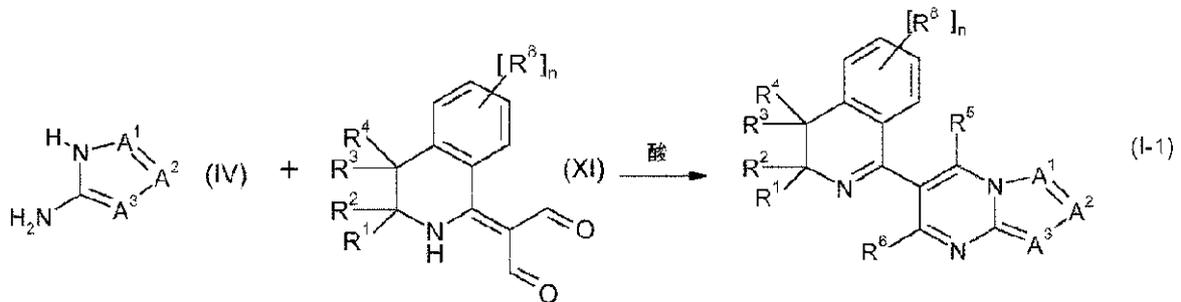


## 【0177】

あるいは、式 I - 1 の化合物（式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および  $n$  は式 I に定義されているとおりである）は、式 IV の化合物（式中、 $A^1$ 、 $A^2$ および  $A^3$  は式 I に定義されているとおりである）の式 XI の化合物（式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^8$ および  $n$  は式 I に定義されているとおりである）を伴う酸性条件下での、例えば塩酸を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム 8 に示されている。

## 【化22】

## スキーム 8



10

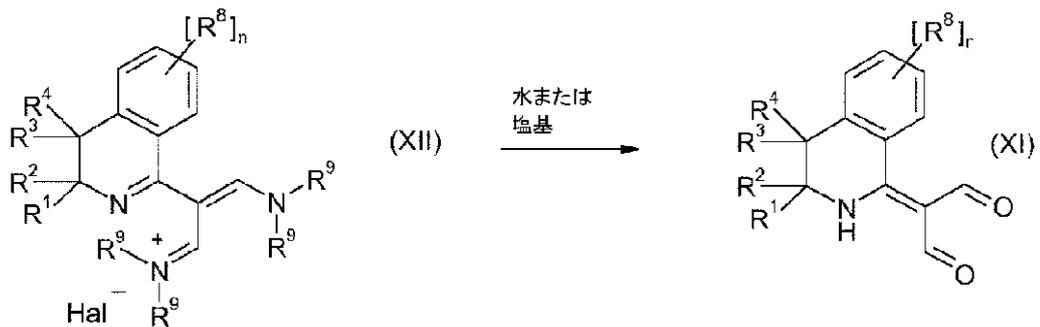
## 【0178】

式 XI の化合物（式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^8$ および  $n$  は式 I に定義されているとおりである）は、式 XII の化合物（式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^8$ および  $n$  は式 I に定義されているとおりであり、 $R^9$  は  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり、ならびに、 $Hal$  はハロゲン、好ましくはクロロもしくはプロモである）の水性または塩基性条件下での変換により得ることが可能である。これはスキーム 9 に示されている。

20

## 【化23】

## スキーム 9



30

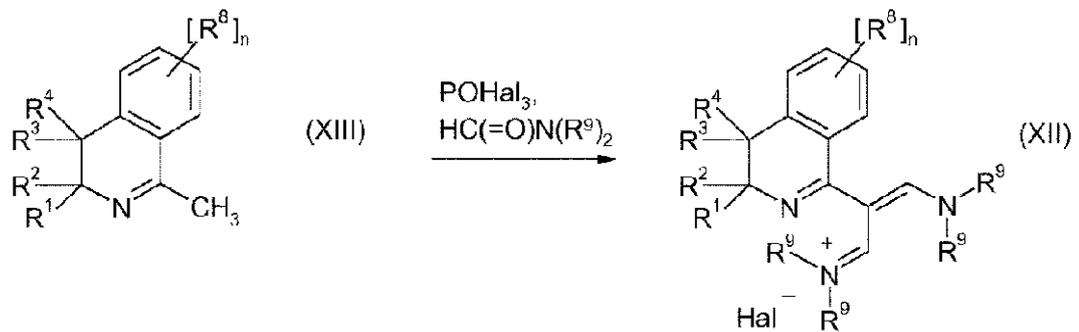
## 【0179】

式 XII の化合物（式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^8$ および  $n$  は式 I に定義されているとおりであり、 $R^9$  は  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり、ならびに、 $Hal$  はハロゲン、好ましくはクロロもしくはプロモである）は、式 XIII の化合物（式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^8$ および  $n$  は式 I に定義されているとおりであり、 $R^9$  は  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり、ならびに、 $Hal$  はハロゲン、好ましくはクロロもしくはプロモである）のオキシ塩化リンまたはオキシ臭化リンなどのオキシハロゲン化リンおよび  $N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_6$  アルキル) ホルムアミドを伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム 10 に示されている。

40

## 【化24】

## スキーム 10

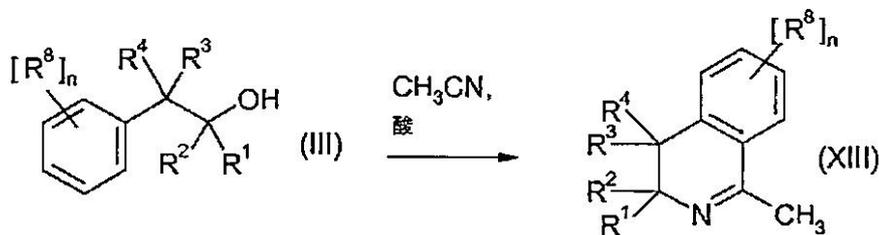


## 【0180】

式XIIIの化合物（式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^8$ および $n$ は式Iに定義されているとおりである）は、式IIIの化合物（式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^8$ および $n$ は式Iに定義されているとおりである）のアセトニトリルを伴う酸性条件下での、例えば硫酸を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム11に示されている。

## 【化25】

## スキーム 11

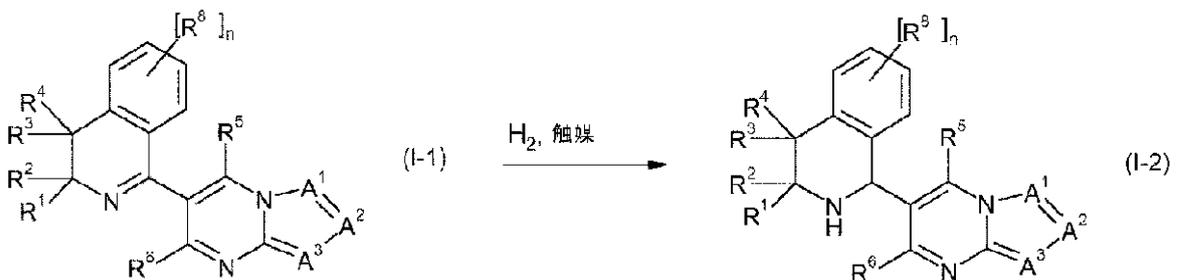


## 【0181】

式I-2の化合物（式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $n$ は式Iに定義されているとおりである）は、式I-1の化合物（式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $n$ は式Iに定義されているとおりである）の還元性の反応条件下での、例えば水素および触媒を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム12に示されている。化合物I-2中のテトラヒドロイソキノリンの環窒素は、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲン化アルキルおよび塩基との反応によりアルキル化（ $R^a = C_1 \sim C_6$ アルキル）されるか、または、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルハロゲン化物および塩基を伴う変換によりアシル化（ $R^a = C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル）されることが可能である。

## 【化26】

## スキーム 12

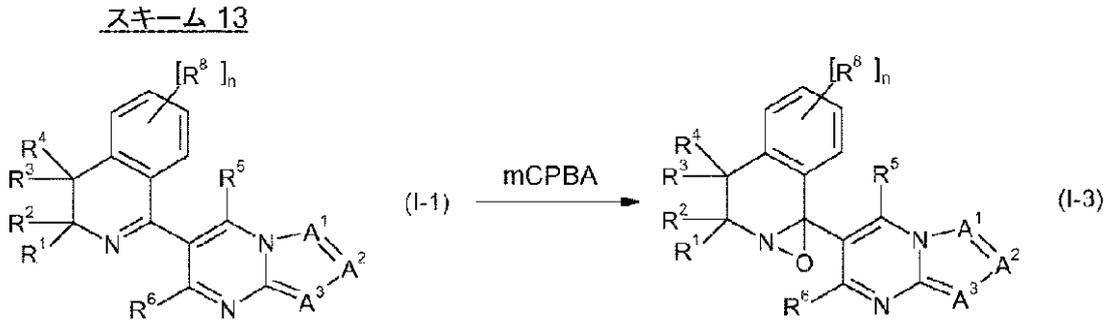


## 【0182】

式I-3の化合物（式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および

nは式Iに定義されているとおりである)は、式I-1の化合物(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ およびnは式Iに定義されているとおりである)の酸化性の反応条件下での、例えばメタクロロ過安息香酸を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム13に示されている。

【化27】



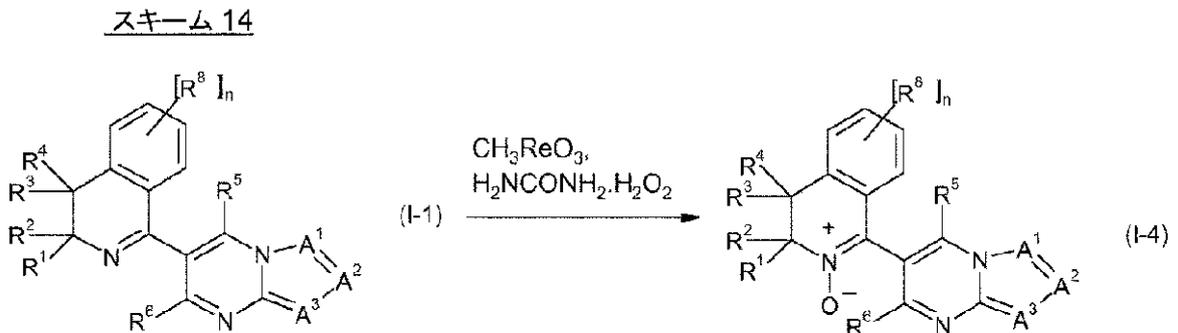
10

【0183】

式I-4の化合物(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ およびnは式Iに定義されているとおりである)は、式I-1の化合物(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ およびnは式Iに定義されているとおりである)の酸化性の反応条件下での、例えばメチルトリオキシレニウムおよび尿素過酸化水素を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム14に示されている。

20

【化28】

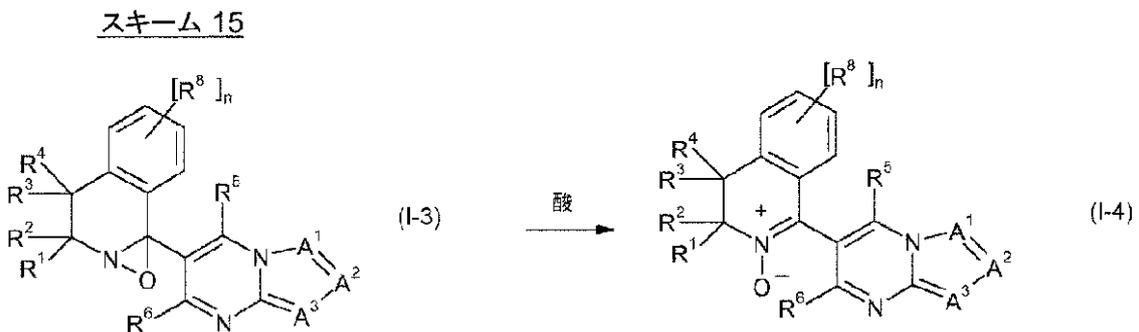


30

【0184】

あるいは、式I-4の化合物(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ およびnは式Iに定義されているとおりである)は、式I-3の化合物(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ およびnは式Iに定義されているとおりである)の酸性条件下での、例えばメタンサルホン酸を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム15に示されている。

【化29】



40

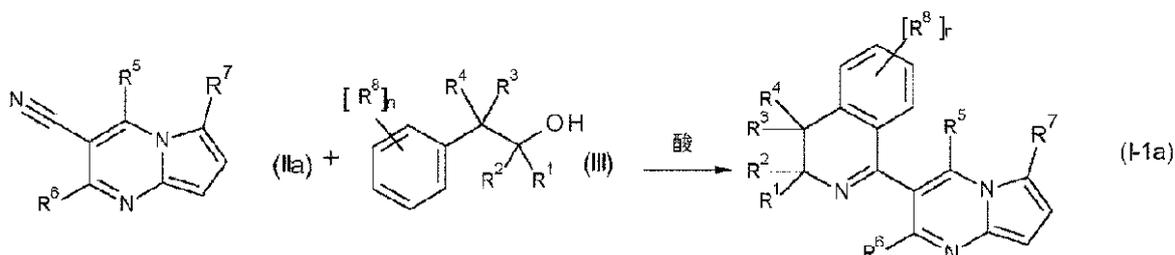
【0185】

50

式 I - 1 a の化合物（式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$  および  $n$  は式 I について定義されているとおりであり、 $A^2$  および  $A^3$  は  $CH$  であり、ならびに、 $A^1$  は  $CR^7$  である）は、化合物 (II a)（式中、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  は式 I について定義されているとおりであり、 $A^2$  および  $A^3$  は  $CH$  であり、ならびに、 $A^1$  は  $CR^7$  である）から開始して、スキーム 1 に従って得ることが可能である。これはスキーム 16 に示されている。

【化 30】

スキーム 16



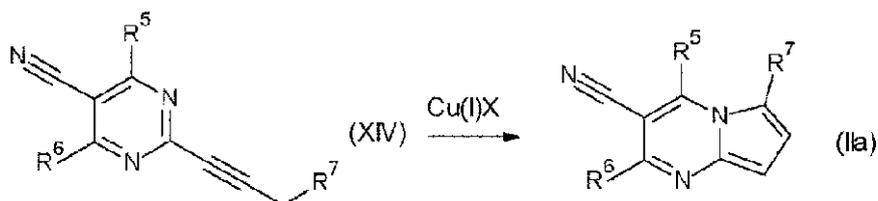
【0186】

式 (II a) の化合物（式中、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  は式 I について定義されているとおりであり、 $A^2$  および  $A^3$  は  $CH$  であり、ならびに、 $A^1$  は  $CR^7$  である）は、例えば  $CuBr$  といった銅塩および例えばトリエチルアミンまたは 1, 8 - ジアザビシクロウンデカ - 7 - エンといった塩基の存在下での、例えば 80 超といった加熱条件下における、式 (XIV) の化合物（式中、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  は式 I について定義されているとおりである）の変換によって得ることが可能である。これはスキーム 17 に示されている。

20

【化 31】

スキーム 17

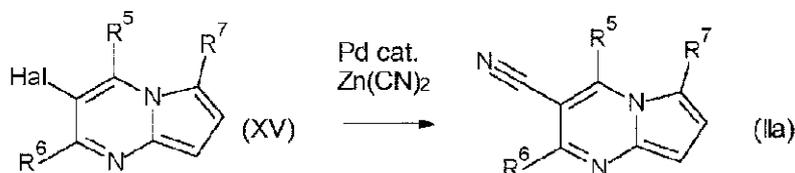


【0187】

あるいは、式 (II a) の化合物（式中、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  は式 I について定義されているとおりであり、 $A^2$  および  $A^3$  は  $CH$  であり、ならびに、 $A^1$  は  $CR^7$  である）は、例えば  $PdCl_2(dppf)$  といった触媒および例えば  $Zn(CN)_2$  といったシアン化物源の存在下における、式 (XV) の化合物（式中、 $Hal$  はハロゲンであり、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  は式 I について定義されているとおりである）の変換により得ることが可能である。これはスキーム 18 に示されている。

【化 32】

スキーム 18



【0188】

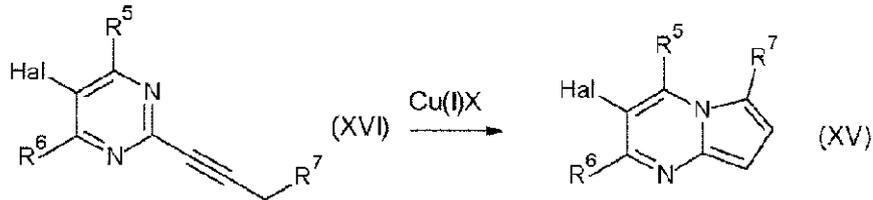
式 (XV) の化合物（式中、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  は式 I について定義されているとおりであり、および、 $Hal$  はハロゲンである）は、例えば  $CuBr$  といった銅塩および例えばト

50

リエチルアミンまたは 1, 8 - ジアザピシクロウンデカ - 7 - エンといった塩基の存在下での、例えば 80 超といった加熱条件下における、式 (XVI) の化合物 (式中、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  は式 I について定義されているとおりであり、および、Hal はハロゲンである) の変換により得ることが可能である。これはスキーム 19 に示されている。

【化 3 3】

スキーム 19



10

【0189】

化合物 (XIV) および (XVI) は公知であるか、または、公知の化合物から開始する技術分野において公知である方法によって調製可能である。

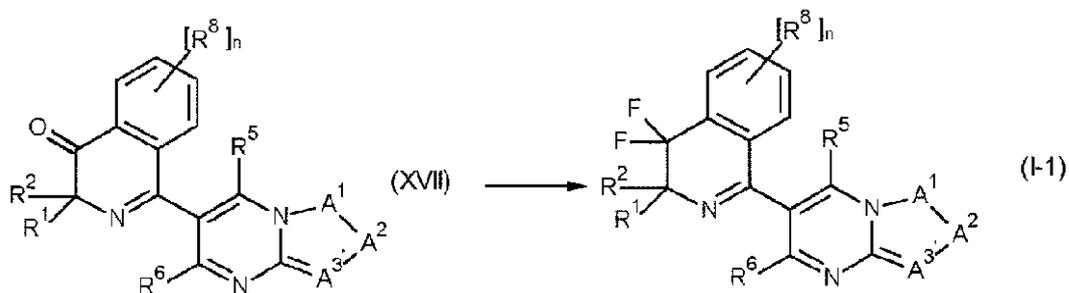
【0190】

式 I - 1 の化合物 (式中、 $R^3$  および  $R^4$  はフルオロであり、ならびに、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$  および  $n$  は式 I に定義されているとおりである) は、式 XVI I の化合物 (式中、 $R^3$  および  $R^4$  は、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C=O$  を表し、ならびに、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$  および  $n$  は式 I に定義されているとおりである) の三フッ化ジエチルアミノ硫黄 (DAST) または 2, 2 - ジフルオロ - 1, 3 - ジメチル - イミダゾリジン (DFI) などのフッ素化試薬を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム 20 に示されている。

20

【化 3 4】

スキーム 20



30

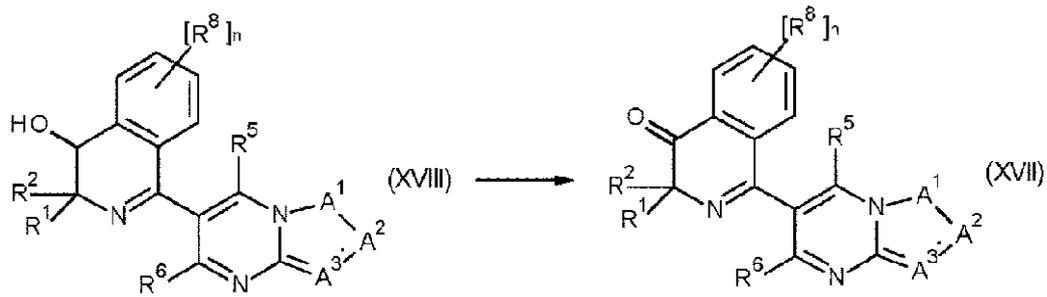
【0191】

式 XVI I の化合物 (式中、 $R^3$  および  $R^4$  は、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C=O$  を表し、ならびに、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$  および  $n$  は式 I に定義されているとおりである) は、式 XVI I I の化合物 (式中、 $R^3$  は水素であり、ならびに、 $R^4$  はヒドロキシであり、ならびに、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$  および  $n$  は式 I に定義されているとおりである) の、1, 1, 1 - トリアセトキシ - 1, 1 - ジヒドロ - 1, 2 - ベンゾイオキシソル - 3 (1H) - オン (デス・マーチン・ペルヨージナン) などの酸化剤を伴う変換により、または、塩化オキサリル、ジメチルスルホキシド (DMSO) およびトリエチルアミンなどの有機塩基 (スワーン酸化) を用いる変換により得ることが可能である。これはスキーム 21 に示されている。

40

## 【化35】

## スキーム 21



10

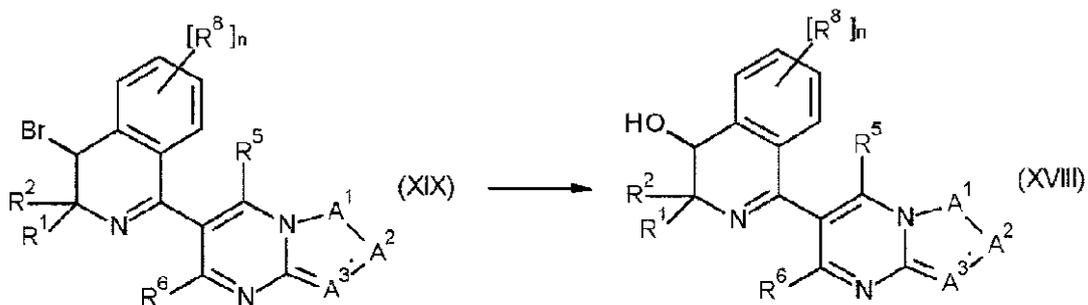
## 【0192】

式XVIIの化合物（式中、 $R^3$ は水素であり、ならびに、 $R^4$ はヒドロキシであり、ならびに、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $n$ は式Iについて定義されているとおりである）は、塩酸などの無機酸または炭酸水素ナトリウムなどの無機塩基の存在下または不在下における、テトラヒドロフランまたは1,4-ジオキサンなどの有機溶剤と水との混合物中における加熱などの加水分解条件下での式XIXの化合物（式中、 $R^3$ は水素であり、ならびに、 $R^4$ はプロモであり、ならびに、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $n$ は式Iについて定義されているとおりである）の変換により得ることが可能である。これはスキーム22に示されている。

20

## 【化36】

## スキーム 22



30

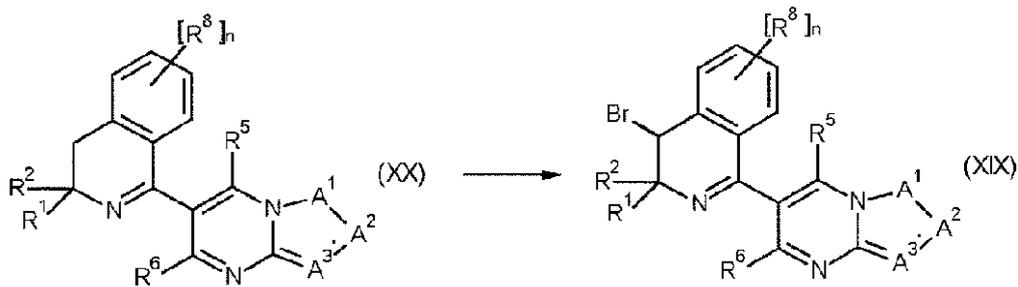
## 【0193】

式XIXの化合物（式中、 $R^3$ は水素であり、ならびに、 $R^4$ はプロモであり、ならびに、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $n$ は式Iに定義されているとおりである）は、式XXの化合物（式中、 $R^3$ および $R^4$ は水素であり、ならびに、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $n$ は式Iに定義されているとおりである）の、N-ブromoハロスクシンイミド（NBS）または1,3-ジブromo-5,5-ジメチルヒダントインなどの臭素化剤を伴う、アゾビスイソブチロニトリル（AIBN）などのラジカル開始剤の存在下での変換により得ることが可能である。これはスキーム23に示されている。

40

## 【化37】

スキーム23



10

## 【0194】

式XXの化合物は、スキーム1に記載の方法に従って得ることが可能である。

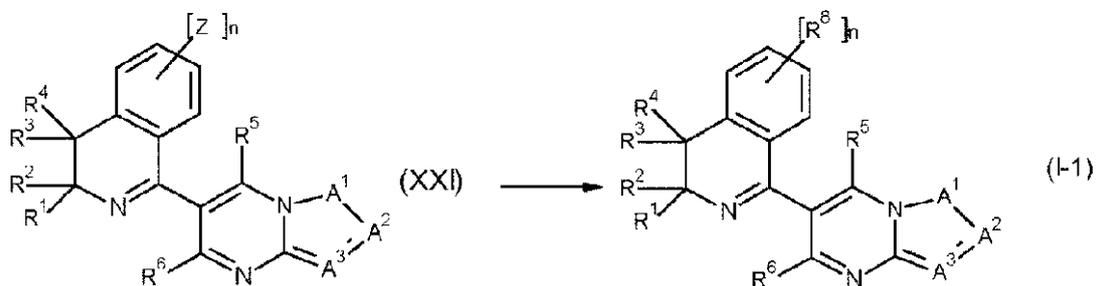
## 【0195】

あるいは、式I-1の化合物(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $n$ は式Iに定義されているとおりである)は、式XXIの化合物(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $n$ は式Iに定義されているとおりであり、ならびに、 $Z$ は溶剤中の臭素またはヨウ素を表す)の、塩基の存在下もしくは不在下、および、カップリング試薬および金属触媒の存在下における変換により得ることが可能である。カップリング剤、触媒、溶剤および塩基は特に限定されず、“Cross-Coupling Reactions: A Practical Guide (Topics in Current Chemistry)”, edited by Norio Miyaura und S. L. Buchwald (editions Springer)、または、“Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions”, edited by Armin de Meijere and Francois Diederich (editions WILEY-VCH)に記載のものなどの通常のカップリング反応において用いられるものである。これはスキーム24に示されている。

20

## 【化38】

スキーム24



30

## 【0196】

さらに、一定の式I-1の化合物(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ および $n$ は式Iに定義されているとおりである)は、他の関連性の高い式I-1の化合物の当業者に公知である標準的な合成技術を用いる変換により得ることが可能である。網羅的ではないが、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、芳香族求核性または求電子性置換反応、求核置換反応、求核性付加反応およびハロゲン化反応が挙げられる。

40

## 【0197】

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。

## 【0198】

50

式 I の化合物は、農業部門および関連する使用分野において、例えば、植物有害生物また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もしくは生物の防除に係る活性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、および、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、予防的特性およ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または植物の一部（果実、花、葉、茎、塊茎、根）に生じる有害生物を阻害または駆除するために、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。

【 0 1 9 9 】

10

式 I の化合物を殺真菌剤 (fungicide) として用いることも可能である。「殺真菌剤」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、または、防止する化合物を意味する。「殺真菌的に有効な量」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、このような化合物またはこのような化合物の組み合わせの量を意味する。防除または変性効果は、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または他の防御形成を含む。

【 0 2 0 0 】

土壤中で発生する真菌性感染症、ならびに、植物病原性真菌に対する保護のために、例えば果実、塊茎もしくは穀粒などの種子または植物挿穂（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、または、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、および、このようにして処理された植物繁殖体にも関する。

20

【 0 2 0 1 】

さらに、本発明に係る化合物は、例えば、木材およ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。

30

【 0 2 0 2 】

加えて、本発明は、例えば材木、壁板およ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。

【 0 2 0 3 】

これらを含む式 I の化合物および殺真菌性組成物を用いて、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、穀類およ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。

40

【 0 2 0 4 】

防除され得る、これらの病害に係る真菌および真菌媒介物、ならびに、植物病原性バクテリアおよびウイルスは、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*)、アフアノミセス属の一種 (*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. ニズランス* (*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 (*Aure*

50

obasidium spp.)、ブラストミセスデルマチチデイス (*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.cinearea*) を含むボトリチス属の一種 (*Botrytis* spp.)、C.アルビカンス (*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ス (*Cephaloascus fragrans*)、セラトシスチス属の一種 (*Ceratocystis* spp.)、C.アラキジコラ (*C.arachidicola*) を含むセルコスボラ属の一種 (*Cercospora* spp.)、セルコスボリ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.)、クラビセプスプルブレア (*Claviceps purpurea*)、

10

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 (*Cryptococcus neoformans*)、ジアボルテ属の一種 (*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.)、

20

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.)、

#### 【0205】

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.langethiae*)、F.モニリホルメ (*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.solanii*) 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*)、グロメララシングレート (*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ドベルギ (*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

30

40

50

の一種 (*Mycosphaerella* spp.)、オンコバシジウムテオブロマエオン (*Oncobasidium theobromaen*)、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. メイデイス* (*P. maydis*)、*P. フィリピンシス* (*P. philippinensis*) および *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*)、ファコプソラパチリジ (*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)、フォーマ属の一種 (*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. ビチコーラ* (*P. viticola*) を含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.)、リンゴうどんこ病菌 (*Ploucotricha*) 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ポトリコイド (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、シュード  
 モナス属の一種 (*Pseudomonas* spp)、*P. クベンシス* (*P. cubensis*)、*P. フムリ* (*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. ホルデイ* (*P. hordei*)、*P. レコンディタ* (*P. recondita*)、*P. ストリイホルミス* (*P. striiformis*)、*P. トリチシナ* (*P. tritricina*) 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. ウルチムム* (*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*)、  
 リンコスボリウム属の一種 (*Rhynchosporium* spp)、*S. アピオスペルムム* (*S. apiospermum*) および *S. プロリフィカンス* (*S. proliferans*) を含むセドスポリウム属の一種 (*Scedosporium* spp.)、  
 スキゾチリウムポミ (*Schizothyrium pomi*)、

## 【0206】

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. ノドルム* (*S. nodorum*)、*S. トリ  
 テイシ* (*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*)、タナテホルスクメリ  
 ス (*Thanatephorus cucumeris*)、チエラビオプシスバシコーラ (

10

20

30

40

50

*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) およびキサントモナス属の一種 (*Xanthomonas* spp)。

10

## 【0207】

特に、これらを含む式Iの化合物および殺真菌性組成物を用いて、担子菌綱 (*Basidiomycete*)、子囊菌綱 (*Ascomycete*)、卵菌綱 (*Oomycete*) および/または不完全菌類、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*) および/またはケカビ綱 (*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。

## 【0208】

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*) およ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*) およ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*) およ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；ならびに、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 zosteriae*)、ペロノスクレロスポラソルギ (*Peronosclerospora sorghi*) およびスクレロスポラグラミニコラ (*Sclerospora graminicola*) などの他のもの。

20

30

40

## 【0209】

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 (*Spiloca*

50

ea oleaginea)、セトスファエリアツルシカ (*Setosphaeria turcica*)、ピレノカエタリコペリシチ (*Pyrenochaeta lycoperisici*)、プレオスポラヘルバルム (*Pleospora herbarum*)、  
 フォマデストルクティバ (*Phoma destructiva*)、ファエオスファエリアヘルボトリコイデス (*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コラ (*Corynespora cassicola*)、コクリオボルスサチブス (*Cochliobolus sativus*)、  
 ビボラリスカクティボラ (*Bipolaris 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コラ (*Alternaria brassicicola*)、  
 アルテルナリアソラニ (*Alternaria solani*) およ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 sojae*)、  
 セルコスポラゼアエマイデイス (*Cercospora zeae-maydis*)、セルコスポレラカプセラエ (*Cercospora capsellae*) およ  
 びセルコスポレラヘルボトリコイデス (*Cercospora herpotrichoides*) などのカプノディウム目 (*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 (*Dothistroma septosporum*)、イサリオプシスクラビスポラ (*Isariopsis clavisporea*)、  
 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*)、ファエオイサリオプシスバタチコラ (*Phaeoisariopsis bataticola*)、  
 シュードセルコスポラビチス (*Pseudocercospora vitis*)、シュードセルコスポレラヘルボトリコイデス (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、  
 ラムラリアベチコラ (*Ramularia beticola*)、ラムラリアコロシグニ (*Ramularia collo-cygni*)、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 (*Magnaportheales*) ;  
 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*)

10

20

30

40

50

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*)、グリネリアウビコーラ(*Greeneria uvicola*)、メランコニウムジュグランドイヌム(*Melanconium juglandinum*)、ホモプシスビティコーラ(*Phomopsis viticola*)、シロコッカスクラビギグネンティ-ジュグランダセアラム(*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*)；ならびに

10

## 【0210】

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ラドクサ(*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ベストリス(*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*)、ギベリナセレアリス(*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、イモチ病または胴枯れ病および/または腐敗病；

20

30

## 【0211】

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(*Griphospaeria corticola*)、カバチエラリニ(*Kabatiella 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*)、モノグラフィアラアルベセンス(*Monographella albescens*)、モノスポラスカノンバルス(*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*)、パラコシジディオイデスブラジリエンシス(*Paracoccidioides bra*

40

50

*siliensis*）、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 gregata*)、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*)、フィサロスボラアブディタ (*Physalospora abdita*)、プレクトスポリウムタバシナム (*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*)、ラムリスポラソルギ (*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.*)、スキゾチリウムポミ (*Schizothyrium pomi*)、スクレロチニアスクレロチオルム (*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 (*Seimatosporium mariae*)、レプテウチパクブレッシ (*Lepteutypa cupressi*)、セプトシタルボルム (*Septocytaruborum*)、スファセロマペルセー (*Sphaeloma perseae*)、スポロネマファシディオイデス (*Sporonema phacidoides*)、スティグミナパルミボラ (*Stigmina palmyra*)、タペシアヤルンデ (*Tapesia yellundae*)、タフリナブラタ (*Taphrina bullata*)、チエビオブシスバシコラ (*Thielaviopsis 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 (*Zygothiala jamaicensis*)；

【0212】

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*)、マイクロスファエラディフサ (*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*) およ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 (*Lasiodiplodia 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 (*Macrophoma*

10

20

30

40

50

mina 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)およ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;ならびに

例えばアクレモニウムストリクツム(Acremonium strictum)、クラビセプスブルブレア(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 nivale)、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)およ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または胴枯れ病。

#### 【0213】

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

口ボキン目(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(Cerotium 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)、または、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ベリ-ビジニアネ(Gymnosporangium juniperi-viginianae)、メランブソラメデュサエ(Melampsora medusae)、ファコブソラパチリジ(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 ampelosis)、トランスケリアディスコロール(Tranzschel

10

20

30

40

50

*ia discolor*) およびウロマイセスビシエ - ファビエ (*Uromyces viciciae-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; ならびに、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ポラ (*Entylomella microspora*)、ネオボシアモリニアエ (*Neovossia molinia*) およ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および病害。

10

## 【0214】

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

20

## 【0215】

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 arrhizus*) などのケカビ綱 (*Mucoromycetes*)。

## 【0216】

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

## 【0217】

その殺真菌活性に追加して、化合物およ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ス (*Strptomyces scabies*) などのバクテリアおよび他の関連する種、ならびに、一定の原生動物に対する活性を有し得る。

30

## 【0218】

本発明の範囲内においては、保護されるべき標的作物および/または有用な植物は、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、ラズベリーおよ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*) ライコムギおよびコムギといった穀類; 例え

ば綿、亜麻、アサ、ジュートおよびサイザルといった繊維植物; 例えば糖質および飼料ビート、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、チャおよ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、セイヨウナシおよびセイヨウスモモといった果樹; 例え

ばバミューダグラス、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、アメリカシバおよ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、セージおよびタイムなどのハーブ; 例え

ばインゲンマメ、レンズマメ、エンドウマメおよびダイズ、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、ピスタチオおよびクルミといった堅果; 例え

ばアブ

40

50

ラヤシといったヤシ；例えば花、低木および高木といった観賞用植物；例えばカカオ、ココナツ、オリーブおよ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、ハウレンソウおよびトマトといった野菜；ならびに、例えばブドウといったつる植物などの多年生および1年生作物を含む。

【0219】

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

10

【0220】

「有用な植物」および/または「標的作物」という用語は、従来の交配また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、または、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、プロスルフロンおよ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 - シンターゼ）抑制剤、GS（グルタミンシンターゼ）抑制剤またはPPO（プロトボルフィリノーゲン - 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。従来の交配方法（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またはあるクラスの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）およびLiberty Link（登録商標）で市販されているグリホサート - およびグルホシネート - 耐性トウモロコシ品種が挙げられる。

20

【0221】

「有用な植物」および/または「標的作物」という用語は、自然発生的なもの、または、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、 $\delta$ -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、ならびに、サソリ、蛛形類、大型のハチ（wasp）およ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。作物また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。

30

40

【0222】

用語「有用な植物」および/または「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0392225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D

50

NA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およ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号パンフレットおよ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。

#### 【0223】

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*) またはバチルスポピリア (*Bacillus popilliae*) 由来の殺虫性タンパク質；または、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1もしくはCry9Cといった - エントキシンなどのバチルスチューリングensis (*Bacillus thuringiensis*) 由来の殺虫性タンパク質、または、例えばVip1、Vip2、Vip3もしくはVip3Aといった栄養型殺虫性タンパク質 (Vip)；または、フォトラブダスルミネセンス (*Photobacterium luminescens*)、ゼノラブダスネマトフィルス (*Xenorhabdus nematophilus*) などの、例えばフォトラブダス属の一種 (*Photobacterium* spp.) もしくはゼノラブダス属の一種 (*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 (wasps) トキシンおよ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、オオムギレクチンまた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、ババ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、ルフィン、サポリンまた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、ナトリウムまた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、スチルベンシンターゼ、ビベンジルシンターゼ、キチナーゼおよびグルカナーゼが挙げられる。

#### 【0224】

さらに、本発明の文脈においては、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1もしくはCry9Cといった - エントキシン、または、例えばVip1、Vip2、Vip3もしくは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、切断型トキシンおよ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)。

#### 【0225】

このようなトキシン、または、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-0 374 753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-0 427 529号明細書、欧州特許出願公開第A-451 878号明細書および国際公開第03/052073号パンフレットに開示されている。

## 【0226】

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。Cry I - タイプデオキシリボ核酸およびその調製は、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号明細書および国際公開第90/13651号パンフレットから公知である。

## 【0227】

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)および蝶(鱗翅目)に通例見出される。

10

## 【0228】

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有する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: Yield Gard (登録商標)(Cry1Abトキシンを発現するトウモロコシ品種); Yield Gard Rootworm (登録商標)(Cry3Bb1トキシンを発現するトウモロコシ品種); Yield Gard Plus (登録商標)(Cry1Abおよび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トキシンおよび酵素ホスフィノトリシン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)(Cry1Actトキシンを発現する綿品種); Bollgard I (登録商標)(Cry1Actトキシンを発現する綿品種); Bollgard II (登録商標)(Cry1AcおよびCry2Abトキシンを発現する綿品種); VipCot (登録商標)(Vip3Aおよび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)CB Advantage (Bt11コーン穿孔性害虫(CB)形質)およびProtecta (登録商標)である。

20

## 【0229】

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。

30

1. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France 製Bt11トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。切断型Cry1Ab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(Ostrinia nubilalis))およびセサミアノナグリオイデス(Sesamia nonagrioides))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(Zea mays)。Bt11トウモロコシはまた、酵素PAT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。

## 【0230】

2. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France 製Bt176トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。Cry1Ab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(Ostrinia nubilalis))およびセサミアノナグリオイデス(Sesamia nonagrioides))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(Zea mays)。Bt176トウモロコシはまた、酵素PAT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。

40

## 【0231】

3. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit

50

27, F-31 790 St. Sauveur, France 製 MIR604 トウモロコシ、登録番号 C / FR / 96 / 05 / 10。修飾 Cry3A 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 Cry3A055 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 03 / 018810 号パンフレットに記載されている。

【0232】

4. Monsanto Europe S.A. 270 - 272 Avenue de Tervuren, B - 1150 Brussels, Belgium 製 MON863 トウモロコシ、登録番号 C / DE / 02 / 9。MON863 は、Cry3Bb1 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。

10

【0233】

5. Monsanto Europe S.A. 270 - 272 Avenue de Tervuren, B - 1150 Brussels, Belgium 製 IPC531 綿、登録番号 C / ES / 96 / 02。

【0234】

6. Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B - 1160 Brussels, Belgium 製 1507 トウモロコシ、登録番号 C / NL / 00 / 10。一定の鱗翅目昆虫に対する耐性を達成するタンパク質 Cry1F の発現、および、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 PAT 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。

20

【0235】

7. Monsanto Europe S.A. 270 - 272 Avenue de Tervuren, B - 1150 Brussels, Belgium 製 NK603 x MON810 トウモロコシ、登録番号 C / GB / 02 / M3 / 03。遺伝子操作品種 NK603 および MON810 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。NK603 x MON810 トウモロコシは、アグロバクテリウム属の一種 (Agrobacterium sp.) の菌株 CP4 から得られるタンパク質 CP4 EPSPS 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ゲンシス (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。

30

【0236】

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

【0237】

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

40

【0238】

「植物繁殖体 (plant propagation material)」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、および、挿し木も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、根茎および植物の部分が挙げられ得る。発芽後もしくは土壌から出芽した後に移植されることとなる発芽した植物およ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また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。

【0239】

50

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。

【0240】

式Iの化合物は、そのままの形態で、または、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、直接噴射可能もしくは希釈可能な溶液または懸濁液、希釈エマルジョン、水和剤、可溶性粉末、粉剤、粒質物、および、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、コーティングまたは掛け流しなどの適用方法が、意図される目的およ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、バインダまたは粘着剤、ならびに、肥料、微量元素の供給源、または、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。

10

【0241】

例えば農業に用いられる好適なキャリアおよび補助剤は、固体また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、例えば天然も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、バインダまたは肥料である。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。

【0242】

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および分散剤を含むと共に、活性を高めるために湿潤剤、ならびに、消泡剤およ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。活性成分の量は濃縮物の0.5%~95%の範囲内であり得る。

20

【0243】

水和剤は、水また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活性成分を含有する。典型的な固体マトリックスとしては、フラー土、カオリンクレイ、シリカおよび他の易湿性の有機もしくは無機固形分が挙げられる。水和剤は通常、5%~95%の活性成分と少量の湿潤剤、分散剤または乳化剤とを含有する。

30

【0244】

乳化性濃縮物は水また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もしくは固体乳化剤とからのみ構成されていてもよく、または、キシレン、高沸点芳香族ナフサ、イソホロンおよ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また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。活性成分の量は濃縮物の0.5%~95%の範囲内であり得る。

【0245】

粒状配合物は押出物およ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、硫酸カルシウムおよび他の有機もしくは無機材料が挙げられる。粒状配合物は通常5%~25%の活性成分を含有し、これは、高沸点芳香族ナフサ、ケロシンおよび他の石油留分などの表面活性剤、もしくは、植物油；ならびに、または、デキストリン、膠もしくは合成樹脂などの展着剤を含んでいてもよい。

40

50

## 【 0 2 4 6 】

粉剤は、活性成分と、分散剤およびキャリアとして作用するタルク、クレイ、粉末ならびに他の有機およ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。

## 【 0 2 4 7 】

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活性成分の小滴または顆粒である。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、押出し成形、凝塊もしくはプリルによって形成されるか、または、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、おがくずおよび粒状炭素である。シェルまたはメンブラン材料は、天然および合成ゴム、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、ポリウレタンおよびデンブンザンデートを含む。

10

## 【 0 2 4 8 】

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、キシレンおよ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活性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活性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。

20

## 【 0 2 4 9 】

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およびキャリアは、当業者に周知である。

## 【 0 2 5 0 】

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、シクロヘキサン、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ピエテート、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、ジプロピレングリコール、ジプロピレングリコールメチルエーテル、ジプロピレングリコールジベンゾエート、ジプロキシトール、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、および、アミルアルコール、テトラヒドロフルフリルアルコー

30

40

50

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、グリセリンおよび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。

【 0 2 5 1 】

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、クルミの外殻粉およびリグニンが挙げられる。

【 0 2 5 2 】

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、前記液体およ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、ノニオン性また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、または、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 . s u b . 1 8 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 . s u b . 1 6 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；エチレンオキシドおよびプロピレンオキシドのブロックコポリマー；ならびに、モノおよびジアルキルリン酸エステルの塩が挙げられる。

【 0 2 5 3 】

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、中和剤および緩衝剤、腐食抑制剤、染料、臭気剤、展着剤、浸透助剤、微量元素、緩和剤、潤滑剤および固着剤が挙げられる。

【 0 2 5 4 】

さらに加えて、他の殺生性活性成分または組成物を、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、および、本発明の組成物と同時にまたは順次に適用してもよい。同時に適用する場合、これらのさらなる活性成分は、本発明の組成物と一緒に配合されても、または、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活性成分は、殺真菌剤、除草剤、殺虫剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤および/または植物成長調節剤であり得る。

【 0 2 5 5 】

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、サリチル酸塩および市販されている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。

【 0 2 5 6 】

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または植物に、さらなる化合物と同時に、または、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、例えば肥料もしくは微量元素供与物、または、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、選択的な除草剤もしくは非選択的な除草剤、ならびに、殺虫剤、殺真菌剤、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、または、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、界面活性剤もしくは適用促進補助剤を

10

20

30

40

50

伴う混合物であることが可能である。

【0257】

式Iの化合物は、活性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もしくは保護のための(殺真菌性)組成物の形態で用いられ得、または、遊離形態も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。

【0258】

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、および、任意選択により補助剤を含む、組成物、好ましくは殺真菌性組成物を提供する。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な化合物、例えば追加の殺真菌性活性成分を含んでいてもよい。

【0259】

式(I)の化合物は、組成物における唯一の活性成分であってもよく、また、適切な場合、有害生物防除剤、殺真菌剤、共力剤、除草剤または植物成長調節剤などの1種以上の追加の活性成分と混合されてもよい。追加の活性成分は、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。

【0260】

好適な追加の活性成分の例としては、以下のアシルアミノ酸殺真菌剤、脂肪族窒素殺真菌剤、アミド殺真菌剤、アニリド殺真菌剤、抗生物質殺真菌剤、芳香族殺真菌剤、ヒ素殺真菌剤、アリールフェニルケトン殺真菌剤、ベンズアミド殺真菌剤、ベンズアニリド殺真菌剤、ベンズイミダゾール殺真菌剤、ベンゾチアゾール殺真菌剤、植物学的殺真菌剤、架橋ジフェニル殺真菌剤、カルバメート殺真菌剤、カルバニレート殺真菌剤、コナゾール殺真菌剤、銅殺真菌剤、ジカルボキシイミド殺真菌剤、ジニトロフェノール殺真菌剤、ジチオカルバメート殺真菌剤、ジチオラン殺真菌剤、フラミド殺真菌剤、フラニリド殺真菌剤、ヒドラジド殺真菌剤、イミダゾール殺真菌剤、水銀殺真菌剤、モルホリン殺真菌剤、有機リン殺真菌剤、有機スズ殺真菌剤、オキサチン殺真菌剤、オキサゾール殺真菌剤、フェニルスルファミド殺真菌剤、ポリスルフィド殺真菌剤、ピラゾール殺真菌剤、ピリジン殺真菌剤、ピリミジン殺真菌剤、ピロール殺真菌剤、第4級アンモニウム殺真菌剤、キノリン殺真菌剤、キノン殺真菌剤、キノキサリン殺真菌剤、ストロビルリン殺真菌剤、スルホンアニリド殺真菌剤、チアジアゾール殺真菌剤、チアゾール殺真菌剤、チアゾリジン殺真菌剤、チオカルバメート殺真菌剤、チオフエン殺真菌剤、トリアジン殺真菌剤、トリアゾール殺真菌剤、トリアゾロピリミジン殺真菌剤、尿素殺真菌剤、バリンアミド殺真菌剤および亜鉛殺真菌剤が挙げられる。

【0261】

好適な追加の活性成分の例としてはまた、以下が挙げられる：3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-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-1H-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-1H-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(1072957-71-1)、1-メチル-3-ジフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸(4'-メチルスルファニル-ピフェニル-2-イル)-アミド、1-メチル-3-ジフルオロメチル-4H-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-プロモ-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-

10

20

30

40

50

メチル - プロブ - 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 - イソキサゾリン - 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 - イミノアセタミド、 4 - プロモ - 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、 a - [ N - ( 3 - クロロ - 2 , 6 - キシリル ) - 2 - メトキシアセタミド ] - y - ブチロラクトン、 4 - クロロ - 2 - シアノ - 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エン - 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、 10  
 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、 ( . + . ) - c i s - 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 - t - 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 ' - ジプロモ - 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 20  
 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 30  
 ] - 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 40  
 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 - t - 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 - [ ( 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 ) - 50

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 -  
 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 ;

10

20

【 0 2 6 2 】

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 ) - フラノンなどのフェノール ;  
 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、アシベタックス  
 、アラニカルブ、アルペンダゾール、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、アモバム、アンプロピルホス、アニラジン、アソメート  
 、オーレオフンギン、アザコナゾール、アザフェンジン、アジチラム、アゾキシストロピ  
 ン、バリウムポリスルフィド、ベナラキシル、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、ベンチアバリカルブ、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  
 、プピリメート、プチオベート、プチルアミン多硫酸カルシウム、カプタホール、キャ  
 タン、カルバモルフ、カルペンダジム、カルペンダジムクロリドレート、カルボキシン、  
 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、クロルピクリン、クロロタロニル、クロロゾリネート、クロゾリネート、ク  
 リンパゾール、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、クロム酸銅亜鉛およびボルドー液などの銅含有化合物、クレゾール、クフラエブ、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

30

40

50

エナミド、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、ジクロン、ジクロラン、ジクロロフ  
 ェン、ジクロゾリン、ジクロブトラゾール、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 , 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、ジノブトン、ジノ  
 カップ、ジノクトン、ジノペントン、ジノスルホン、ジノテルボン、ジフェニルアミン、  
 ジピリチオン、ジスルフィラム、ジタリムホス、ジチアノン、ジチオエーテル、ドデシル  
 ジメチル塩化アンモニウム、ドデモルフ、ドジチン、ドジン、ドグアジン、ドラゾキシロ  
 ン、エディフェンホス、エネストロブリン、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、フェンアミドン、フェナミノ  
 スルフ、フェナパニル、フェナリモル、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェンヘキ  
 サミド、フェニトロパン、フェノキサニル、フェンピクロニル、フェンプロピジン、フェ  
 ンプロピモルフ、フェンピラザミン、酢酸トリフェニルスズ、トリフェニルスズヒドロキ  
 シド、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 ( f  
 l u m e t o v e r )、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  
 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  
 ペット、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、ルフラール、フルメシクロックス、フロファネート、  
 グリオジン、グリセオフラビン、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、イプロベンホス、イプロジオン、イプロバリカルブ、イソブ  
 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、イゾパムホス、カスガマイシン、クレソキシム - メチル、L Y 1 8 6 0 5 4、  
 L Y 2 1 1 7 9 5、L Y 2 4 8 9 0 8、マンコゼブ、マンジプロバミド、マンネブ、メベ  
 ニル、メカルピンジド、メフェノキサム、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  
 ソロン、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、マイクロブタニル、マイクロゾリン  
 、ナーバム、ナタミシン、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、オキサスルフロソ、オキ  
 シン銅、オキシソリン酸、オキスポコナゾール、オキシカルボキシン、パリノール、ペフラ  
 ゴエート、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 - A 1  
 、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  
 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、ピラカルボリド、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 4 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

10

20

30

40

50

ル、サントニン、セダキサシ、シルチオファミ、シメコナゾール、シブコナゾール、5 塩化石炭酸ナトリウム、ソラテノール、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、チオファネート - 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、チオキサミド、トルコホス - 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ビン、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、およびゾキサミド。

10

## 【0263】

本発明の化合物はまた、駆虫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号明細書および欧州特許第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、エピリノメクチン、ドラメクチン、セラメクチン、モキシデクチン、ネマデクチンおよ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号パンフレットおよび国際公開第9522552号パンフレットに記載されているものなどの半合成およ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、オキシフェンダゾール、オキシベンダゾール、パルベンダゾール、および、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、イミダゾチアゾール、および、テトラミソール、レバミゾール、パモ酸ピランテル (pyrantel pamoate)、オキサニテルまたはモランテルなどの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およびクロールロンなどのフルキシド、ならびに、プラジカンテルおよびエブシプランテルなどのセストサイド (cestocide) が挙げられる。

20

## 【0264】

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および類似体、ならびに、米国特許第5478855号明細書、米国特許第4639771号明細書および独国特許第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。

30

## 【0265】

本発明の化合物は、国際公開第9615121号パンフレット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および類似体との組み合わせで、また、国際公開第9611945号パンフレット、国際公開第9319053号パンフレット、国際公開第9325543号パンフレット、欧州特許第626375号明細書、欧州特許第382173号明細書、国際公開第9419334号パンフレット、欧州特許第382173号明細書、および、欧州特許第503538号明細書に記載のものなどの駆虫活性環式デブシペプチドとの組み合わせで用いられ得る。

40

## 【0266】

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；テブフェノジド等などのエクジソンアゴニスト；イミダクロプリド等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。

## 【0267】

本発明の化合物は、例えば国際公開第95/19363号パンフレットまたは国際公開第04/72086号パンフレットに記載のものといったテルペンアルカロイドであって

50

、特にこれらに開示の化合物との組み合わせで用いられ得る。

【0268】

本発明の化合物が組み合わされて用いられ得るこのような生物学的に有効な化合物の他の例としては、これらに限定されることはないが、以下が挙げられる。

【0269】

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、クロルフェンピンホス、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、ダイアジノン、ジクロルボス、ジクロトホス、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、フェントロチオン、フェンスルホチオン、フェンチオン、フルピラゾホス、フォノホス、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、パラオキソン、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、ピリダペンチオン、キナルホス、スルプロホス、テメホス、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

20

【0270】

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、フェンチオカルブ、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、メソミル、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、ピリミカーブ、プロボキシル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、UC - 51717。

【0271】

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 ) - ( 1R ) - 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、 - 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、エムペントリン、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 ( 天然生成物 )、レスメスリン、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。

30

40

【0272】

節足動物成長調節剤：a) キチン合成抑制剤：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、クロルフェンタジン；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、メトプレン ( S - メトプレンを含む )、フェノキシカルブ；d) 脂質生合成抑制剤：スピロジクロフェン。

【0273】

50

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エンシス (*Bacillus thuringiensis*)、ベンサルタップ、ピフェナゼート、ピナパクリル、プロモプロピレート、BTG - 504、BTG - 505、カンフェクロール、カルタップ、クロロベンジレート、クロルジメホルム、クロルフェナピル、クロマフェノジド、クロチアニジン (*clothianidine*)、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 (*halofenprox*)、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、プロトリフェンプト、ピメトロジン (*pymethrozine*)、ピリダベン、ピリミジフェン、NC - 1111、R - 195、RH - 0345、RH - 2485、RYI - 210、S - 1283、S - 1833、SI - 8601、シラフルオフエン、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 (*tetranactin*)、チアクロブリド、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、トリナクチン、ベルブチン、ベルタレク、YI - 5301。

10

【0274】

20

生物剤：バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis* ssp *aizawai*, *kurstaki*)、バチルスチューリングエンシス (*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、ウイルスおよび真菌。

【0275】

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。

【0276】

他の生物剤：エンロフロキサシン、フェバンテル、ペネタメート、モロキシカム、セファレキシン、カナマイシン、ピモベンダン、クレンブテロール、オメブラゾール、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、ブラジクアランテル、トリクラベンダゾール。

30

【0277】

式Iの化合物と活性成分との以下の混合物が好ましい(「TX」という略記は、「本発明の表A1~A27、B1~B12、C1~C12およびD1~D5(上記)に記載の化合物からなる群から選択される1種の化合物」を意味する)。

石油(代替名)(628)+TXから構成される物質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)(910)+TX、2,4-ジクロロフェニルベンゼンスルホネート(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1059)+TX、2-フルオロ-N-メチル-N-1-ナフチルアセタミド(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、シペルメトリン(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、AVI382(化合物コード)+TX、AZ60541(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

40

50

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(907)+TX、プロフェンバレレート(代替名)+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、ブトカルボキシム(103)+TX、ブトキシカルボキシム(104)+TX、ブチルピリダベン(代替名)+TX、多硫酸カルシウム(IUPAC名)(111)+TX、カンフェクロール(941)+TX、カルバノレート(943)+TX、カルパリル(115)+TX、カルボフラン(118)+TX、カルボフェノチオン(947)+TX、CGA50'439(開発コード)(125)+TX、チノメチオナート(126)+TX、クロルベンシド(959)+TX、クロルジメホルム(964)+TX、クロルジメホルムヒドロクロリド(964)+TX、クロルフェナピル(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、クロルフェンピンホス(131)+TX、クロロベンジラート(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、シネリンス(696)+TX、クロフェンテジン(158)+TX、クロサンテル(代替名)[CCN]+TX、クマホス(174)+TX、クロタミトン(代替名)[CCN]+TX、クトロキシホス(1010)+TX、クフラエブ(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(1032)+TX、DDT(219)+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)+TX、ダイアジノン(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、ジエノクロー(1071)+TX、ジメホクス(1081)+TX、ジメトエート(262)+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(1089)+TX、ジノプトン(269)+TX、ジノカップ(270)+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(1097)+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)[CCN]+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、  
**【0278】**  
 エンドスルファン(294)+TX、エンドチオン(1121)+TX、EPN(297)+TX、エピリノメクチン(代替名)[CCN]+TX、エチオン(309)+TX、エトエートメチル(1134)+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、酸化フェンブタズ(330)+TX、フェノチオカルブ(337)+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

10

20

30

40

50

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(1169)+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、FMC1137(開発コード)(1185)+TX、ホルメタネート(405)+TX、ホルメタネートヒドロクロリド(405)+TX、ホルモチオン(1192)+TX、ホルムパラネート(1193)+TX、-HCH(430)+TX、グリオジン(1205)+TX、ハルフェンブロクス(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/Chemical Abstracts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、ジヨドフェンホス(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、メホスフォラン(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、メソミル(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、ミルマイシンオキシム(代替名)[CCN]+TX、ミパホクス(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、ニッコマイシン(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、プロペタムホス(673)+TX、プロポキスル(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、キンチオホス(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、スルフラミド(750)+TX、スルホテブ(753)+TX、スルフル(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

10

20

30

40

50

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、トリナクチン(代替名)(653)+TX、バミドチオン(847)+TX、バニリプロール[CCN]およびYI-5302(化合物コード)+TXから構成される物質群から選択される殺ダニ剤、  
【0279】

10

ベトキサジン[CCN]+TX、ニオクタノン酸銅(IUPAC名)(170)+TX、硫酸銅(172)+TX、シプトリン[CCN]+TX、ジクロン(1052)+TX、ジクロロフェン(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、キノンアミド(1379)+TX、シマジン(730)+TX、酢酸トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)および水酸化トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)+TXから構成される物質群から選択される殺藻剤、  
【0280】

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、エピリノメクチン(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)およびチオファネート(1435)+TXから構成される物質群から選択される駆虫薬、  
【0281】

20

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)およびストリキニン(745)+TXから構成される物質群から選択される殺鳥剤、  
【0282】

30

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、8-硫酸ヒドロキシキノリン(446)+TX、プロノポール(97)+TX、ニオクタノン酸銅(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、ドジチン(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、カスガマイシンヒドロクロリド水和物(483)+TX、ニッケルビス(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、およびチオメルサル(代替名)[CCN]+TXから構成される物質群から選択される殺バクテリア剤、  
【0283】

40

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、アムブリセイウス属の一種(Amblyseius spp.)(代替名)(19)+TX、アナグラファファルシフェラ

50

(*Anagrapta 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、オートグラフィアカリホルニカ (*Autographa californica*  
 NPV) (代替名) (38) + TX、バシラスフィルムス (*Bacillus firm*  
*us*) (代替名) (48) + TX、バシラススファエリクス (*Bacillus sph*  
*aericus Neide*) (学名) (49) + TX、バチルスチューリングェンシス (*Bacillus thuringiensis Berliner*) (学名) (51) 10  
 + TX、バチルスチューリングェンシス (*Bacillus thuringiensis*  
*subsp. aizawai*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングェンシス  
 (*Bacillus thuringiensis subsp. israelensis*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングェンシス (*Bacillus thu*  
*ringiensis subsp. japonensis*) (学名) (51) + TX、  
 バチルスチューリングェンシス (*Bacillus thuringiensis sub*  
*sp. kurstaki*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングェンシス (*Ba*  
*cillus thuringiensis subsp. tenebrionis*) (学名) (51) + TX、  
 ベアウベリアバツシアナ (*Beauveria bassiana*) (代替名) (53) + TX、ベアウベリアブロングニアルチイ (*Beauveria* 20  
*brongniartii*) (代替名) (54) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chr*  
*ysoperla carnea*) (代替名) (151) + TX、ツマアカオオヒメテン  
 トウ (*Cryptolaemus montrouzieri*) (代替名) (178) +  
 TX、コドリガ (*Cydia pomonella*) GV (代替名) (191) + TX  
 、ハモグリコマコバチ (*Dacnusa sibirica*) (代替名) (212) + T  
 X、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (代替名) (254) + T  
 X、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (学名) (293) + T  
 X、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (代替名) (30  
 0) + 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* 30  
*bacteriophora*) および H. メギジス (*H. megidis*) (代替名)  
 (433) + TX、ヒポダミアコンベルゲンス (*Hippodamia converg*  
*ens*) (代替名) (442) + TX、フジコナヒゲナガトビコバチ (*Leptomast*  
*tix 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) (5  
 22) + TX、メタリジウムアニソプリアエ (*Metarhizium anisopli*  
*iae var. acridum*) (学名) (523) + TX、メタリジウムアニソプリア  
 エ (*Metarhizium anisopliae var. anisopliae* 40  
 ) (学名) (523) + TX、マツノキハバチ (*Neodiprion sertife*  
*r* NPV) および N. レコンテイ (*N. lecontei* NPV) (代替名) (57  
 5) + TX、ヒメハナカメムシ属の一種 (*Orius spp.*) (代替名) (596)  
 + TX、パエシロマイセスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosor*  
*oseus*) (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 (*Spod*  
*optera exigua*) マルチカブシド核多角体ウイルス (学名) (741) + T  
 X、ステイナーネマビビオニス (*Steinernema bibionis*) (代替名)  
 (742) + TX、ステイナーネマカルポカブサエ (*Steinernema car*  
*pocapsae*) (代替名) (742) + TX、ステイナーネマフェルチアエ (*Ste* 50

inerinema feltiae) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマグラセリ (Steinerinema glaseri) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマリオブラエb (Steinerinema riobrave) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマリオブラビス (Steinerinema riobravis) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマスカプテリスキ (Steinerinema scapterisci) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマ属の一種 (Steinerinema spp.) (代替名) (742) + TX、トリコグラマ属の一種 (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) およびベルチシリウムレカニイ (Verticillium lecanii) (代替名) (848) + TX から構成される物質群から選択される生物剤、

10

## 【0284】

ヨードメタン (IUPAC名) (542) および臭化メチル (537) + TX から構成される物質群から選択される土壤不毛剤、

## 【0285】

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] およびウレデパ (代替名) [CCN] + TX から構成される物質群から選択される不妊化剤、

20

## 【0286】

(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) - イコス - 13 - エン - 10 - オン (IUPAC名) (448) + TX、(Z) - テトラデカ - 7 - エン - 1 - アル (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、 - ムルチストリアチン (代替名) [CCN] + TX、プレビコミン (代替名) [CCN] + TX、コドレルレ (代替名) [CCN] + TX、コドレモン (代替名) (167) + TX、クエルレ (代替名) (179) + TX、ジスパールア (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、フロンタリン (代替名) [CCN]

30

40

50

+ TX、ゴシップラア(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、イプスジエノール(代替名)[CCN]+TX、イブセノール(代替名)[CCN]+TX、ジャポニルア(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)+TX、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B<sub>1</sub>(代替名)(839)+TX、トリメドルアB<sub>2</sub>(代替名)(839)+TX、トリメドルアC(代替名)(839)およびトランクコール(代替名)[CCN]+TXから構成される物質群から選択される昆虫フェロモン、

【0287】

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、ジブチルアジペート(IUPAC名)(1046)+TX、フタル酸ジブチル(1047)+TX、ジブチルコハク酸塩(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、ジメチルフタレート[CCN]+TX、エチルヘキサンジオール(1137)+TX、ヘキサミド[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]およびピカリジン[CCN]+TXから構成される物質群から選択される昆虫忌避剤、

【0288】

1-ジクロロ-1-ニトロエタン(IUPAC/Chemical Abstracts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/Chemical Abstracts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/Chemical Abstracts名)(916)+TX、2,2,2-トリクロロ-1-(3,4-ジクロロフェニル)酢酸エチル(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リン酸(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/Chemical Abstracts名)(1109)+TX、2-(2-ブトキシエトキシ)エチルチオシアネート(IUPAC/Chemical Abstracts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/Chemical Abstracts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リン酸(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(プロブ-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-クロロプロブ-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

10

20

30

40

50

ルバメート (IUPAC名) (1283) + TX、4 - メチル (プロブ - 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、アセタミブリド (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、AVI382 (化合物コード) + TX、AZ60541 (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グゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) エンドトキシン (代替名) (52) + TX、バリウムヘキサフルオロシリケート (代替名) [CCN] + TX、バリウムポリスルフィド (IUPAC / Chemical Abstracts名) (892) + TX、バルトリン [CCN] + TX、バイエル22 / 190 (開発コード) (893) + TX、バイエル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、ベンサルタップ (66) + TX、 - シフルトリン (194) + TX、 - シペルメトリン (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、バイオエタノメトリン [CCN] + TX、ピオパーメトリン (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、ビストリフルロン (83) + TX、ホウ酸ナトリウム (86) + TX、プロフェンバレレート (代替名) + TX、プロムフェンビンホス (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、ブフェンカルブ (924) + TX、ブプロフェジン (99) + TX、ブタカルブ (926) + TX、ブタチオホス (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、ブチルピリダベン (代替名) + TX、

## 【0289】

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、多硫酸カルシウム (IUPAC名) (111) + TX、カンフェクロール (941) + TX、カルバノレート (943) + TX、カルバリル (115) + TX、カルボフラン (118) + TX、二硫化炭素 (IUPAC / Chemical Abstracts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、カルタップ (123) + TX、カルタップヒドロクロリド (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、クロルジメホルムヒドロクロリド (964) + TX、クロルエトキシホス (129) + TX、クロルフェナビル (130) + TX、クロルフェンビンホス (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、クロルピクリン (141) + TX、クロルホキシム (989) + TX、クロルブラゾホス (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 (69

10

20

30

40

50

6) + TX、シネリンII (696) + TX、シネリンス (696) + TX、cis - レスメスリン (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、シチオエート (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) + TX、ジアミダホス (1044) + TX、ダイアジノン (227) + TX、ジカプトン (1050) + TX、ジクロロフェンチオン (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、ディルドリン (1070) + TX、ジエチル5 - メチルピラゾール - 3 - イルリン酸 (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、

【0290】

エクジステロン (代替名) [CCN] + TX、EI1642 (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、エムペントリン (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、エピリノメクチン (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、エチオフエンカルブ (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、エチレンジブロミド (316) + TX、ジクロロエタン (化学名) (1136) + TX、エチレンオキシド [CCN] + TX、エトフェンブロックス (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、フェンクロールホス (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、フルフェンブロックス (1171) + TX、フルメトリン (372) + TX、フルバリネート (1184) + TX、FMC1137 (開発コード) (1185) + TX、フォノホス (1191) + TX、ホルメタネート (405) + TX、ホルメタネートヒドロクロリド (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、ハルフェンブロックス (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、ヒドラメチルノン (443) + TX、シアン化水素 (444) + TX、ヒドロプレン (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、

10

20

30

## 【0291】

ジャスモリンI (696) + TX、ジャスモリンII (696) + TX、ジヨドフェンホス (1248) + TX、幼虫ホルモンI (代替名) [CCN] + TX、幼虫ホルモンII (代替名) [CCN] + TX、幼虫ホルモンIII (代替名) [CCN] + TX、ケレバン (1249) + TX、キノプレン (484) + TX、  
 - シハロトリン (198) + TX、硫酸鉛 [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、ルフェヌロン (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、マジドクス (1255) + TX、メカルバム (502) + TX、メカルホン (1258) + TX、メナゾン (1260) + TX、メホスフォラン (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、ノルニコチン (IUPAC / Chemical Abstracts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、メソミル (531) + TX、メトプレン (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

40

50

)+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、メチルククロホルム(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/Chemical Abstracts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、ニコチンスルフェート(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-ジククロ-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-イルホスホロチオネート(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-イルホスホロチオネート(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、

【0292】

pp'-DDT(219)+TX、パラ-ジククロベンゼン[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、ペンタククロフェノール(623)+TX、ラウリン酸ペンタククロフェニル(IUPAC名)(623)+TX、ベルメトリン(626)+TX、石油(代替名)(628)+TX、PH60-38(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、ピリミカーブ(651)+TX、ピリミホスエチル(1345)+TX、ピリミホスメチル(652)+TX、ポリククロジシクロペンタジエン異性体(IUPAC名)(1346)+TX、ポリククロテルベン(慣習名)(1347)+TX、亜ヒ酸カリウム[CCN]+TX、カリウムチオシアネート[CCN]+TX、プラレトリン(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、プロベタムホス(673)+TX、プロボキスル(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、プロトリフェンブト[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

10

20

30

40

50

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、キンチオホス(1381)+TX、R-1492(開発コード)(1382)+TX、ラホキサニド(代替名)[CCN]+TX、レスメスリン(719)+TX、ロテノン(722)+TX、RU15525(開発コード)(723)+TX、RU25475(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、SN72129(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、ナトリウムフッ化物(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1399)+TX、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム(1400)+TX、ペンタクロロフェノキシドナトリウム塩(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、スルフラミド(750)+TX、スルホテブ(753)+TX、スルフリルフッ化物(756)+TX、スルプロホス(1408)+TX、

## 【0293】

タール油(代替名)(758)+TX、 -フルバリネート(398)+TX、チオナジン(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、テラレスリン(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、テトラクロルピホス(777)+TX、テトラメトリン(787)+TX、 -シペルメトリン(204)+TX、チアクロプリド(791)+TX、チアフェノクス(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、チオシクラム水素オキサレート(798)+TX、チオジカルブ(799)+TX、チオフアノックス(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、トランスパーメトリン(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、トリブレン(1459)+TX、パミドチオン(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、 -シペルメトリン(205)+TX、メトリン(代替名)+TX、亜鉛ホスフィド(640)+TX、ゾラプロホス(1469)およびZXI8901(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[2

10

20

30

40

50

03313 - 25 - 1 ] + TX、スルホキサフロル [ 946578 - 00 - 3 ] + TX、フルフィプロール [ 704886 - 18 - 0 ] + TX、メペルフルトリン [ 915288 - 13 - 0 ] + TX、テトラメチルフルトリン [ 84937 - 88 - 2 ] + TX、トリフルルメゾピリム (国際公開第2012/092115号パンフレットに開示されている) + TXから構成される物質群から選択される殺虫剤、

【0294】

ビス(トリブチルスズ)オキシド (IUPAC名) (913) + TX、プロモアセタミド [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、第二鉄リン酸 (IUPAC名) (352) + TX、メタアルデヒド (518) + TX、メチオカルブ (530) + TX、ニコロアミド (576) + TX、ニコロアミドオラミン (576) + TX、ペンタクロロフェノール (623) + TX、ペンタクロロフェノキシドナトリウム塩 (623) + TX、チオナジン (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) およ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から構成される物質群から選択される殺軟体動物剤、

【0295】

AKD-3088 (化合物コード) + TX、1, 2 - ジブromo - 3 - クロロプロパン (IUPAC / Chemical Abstracts名) (1045) + TX、1, 2 - ジクロロプロパン (IUPAC / Chemical Abstracts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 / Chemical Abstracts名) (1065) + TX、3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチルロダニン (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、AZ60541 (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、カズサホス (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、クロルピクリン (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、エピリノメクチン (代替名) [CCN] + TX、エトプロホス (312) + TX、エチレンジブromid (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、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、カイネチン (代替名) (210) + TX、メカルホン (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、ミロテシウム

10

20

30

40

50

ベルカリア (*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/Chemical Abstracts 名) (1422) + TX、チアフエノクス (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) およびゼアチン (代替名) (210) + TX、フルエンズルホン [318290-98-1] + TX から構成される物質群から選択される殺線虫剤、

10

## 【0296】

エチルキサントゲン酸カリウム [CCN] およびニトラピリン (580) + TX から構成される物質群から選択される硝化抑制剤、

## 【0297】

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) およびオオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*) 抽出物 (代替名) (720) + TX から構成される物質群から選択される植物活性化剤、

## 【0298】

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、プロジファクム (89) + TX、プロマジオロン (91) + TX、ブロメタリン (92) + TX、シアン化カルシウム (444) + TX、クロラロース (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、ジフェナクム (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、フルオロアセタミド (379) + TX、フルプロパジン (1183) + TX、フルプロパジンヒドロクロリド (1183) + TX、-HCH (430) + TX、HCH (430) + 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、ホスアセチム (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、ストリキニン (745) + TX、硫酸タリウム [CCN] + TX、ワルファリン (851) および亜鉛ホスフィド (640) + TX から構成される物質群から選択される殺鼠剤、

20

30

40

## 【0299】

2-(2-プトキシエトキシ)-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、MGK264 (開発コード) (296) + TX、ピペロニルプトキシド (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、セサスモリン (1394) およびスル

50

ホキシド(1406) + TXから構成される物質群から選択される共力剤、

【0300】

アントラキノン(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、ダイアジノン(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]およびジラム(856) + TXから構成される物質群から選択される動物忌避剤、

【0301】

イマニン(代替名)[CCN]およびリバピリン(代替名)[CCN] + TXから構成される物質群から選択される抗ウイルス剤、

【0302】

酸化水銀(II)(512) + TX、オクチリノン(590)およびチオファネートメチル(802) + TXから構成される物質群から選択される創傷保護剤、ならびに

【0303】

アザコナゾール(60207-31-0) + TX、ピテルタノール[70585-36-3] + TX、プロムコナゾール[116255-48-2] + TX、シプロコナゾール[94361-06-5] + TX、ジフェンコナゾール[119446-68-3] + TX、ジニコナゾール[83657-24-3] + 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、フルトリアホール[76674-21-0] + 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、メトコナゾール[125116-23-6] + TX、マイクロブタニル[88671-89-0] + TX、ペフラゾエート[101903-30-4] + TX、ペンコナゾール[66246-88-6] + TX、プロチオコナゾール[178928-70-6] + TX、ピリフェノックス[88283-41-4] + TX、プロクロラズ[67747-09-5] + TX、プロピコナゾール[60207-90-1] + TX、シメコナゾール[149508-90-7] + TX、テブコナゾール[107534-96-3] + TX、テトラコナゾール[112281-77-3] + TX、トリアジメホン[43121-43-3] + TX、トリアジメノール[55219-65-3] + TX、トリフルミゾール[99387-89-0] + TX、トリチコナゾール[131983-72-7] + TX、アンシミドール[12771-68-5] + TX、フェナリモル[60168-88-9] + TX、ヌアリモル[63284-71-9] + TX、ブピリメート[41483-43-6] + TX、ジメチリモール[5221-53-4] + TX、エチリモール[23947-60-6] + TX、ドデモルフ[1593-77-7] + TX、フェンブロピジン[67306-00-7] + TX、フェンブプロピモルフ[67564-91-4] + TX、スピロキサミン[118134-30-8] + TX、トリデモルフ[81412-43-3] + TX、シプロジニル[121552-61-2] + TX、メパニピリム[110235-47-7] + TX、ピリメタニル[53112-28-0] + TX、フェンピクロニル[74738-17-3] + TX、フルジオキシソニル[131341-86-1] + TX、ベナラキシル[71626-11-4] + TX、フララキシル[57646-30-7] + TX、メタラキシル[57837-19-1] + TX、R-メタラキシル[70630-17-0] + TX、オフレース[58810-48-3] + TX、オキサジキシル[77732-09-3] + TX、ベノミル[17804-35-2] + TX、カルベンダジム[10605-21-7] + TX、デバカルブ[62732-91-6] + TX、フベリダゾール[3878-19-1] + TX、チアベンダゾール[148-79-8] + TX、クロゾリネート[84332-86-5] + TX、ジクロゾリン[2

10

20

30

40

50

4201-58-9]+TX、イブロジオン[36734-19-7]+TX、ミクロゾ  
 リン[54864-61-8]+TX、プロシミドン[32809-16-8]+TX、  
 ピンクロゾリン[50471-44-8]+TX、ボスカリド[188425-85-6  
 ]+TX、カルボキシシン[5234-68-4]+TX、フェンフラム[24691-8  
 0-3]+TX、フルトラニル[66332-96-5]+TX、メプロニル[5581  
 4-41-0]+TX、オキシカルボキシシン[5259-88-1]+TX、ペンチオピ  
 ラド[183675-82-3]+TX、チフルザミド[130000-40-7]+T  
 X、グアザチン[108173-90-6]+TX、ドジン[2439-10-3][1  
 12-65-2](遊離塩基)+TX、イミノクタジン[13516-27-3]+TX  
 、アゾキシストロピン[131860-33-8]+TX、ジモキシストロピン[149  
 961-52-4]+TX、エネストロピン{Proc.BCPC,Int.Congr  
 .,Glasgow,2003,1,93}+TX、フルオキサストロピン[36137  
 7-29-9]+TX、クレソキシムメチル[143390-89-0]+TX、メトミ  
 ノストロピン[133408-50-1]+TX、トリフロキシストロピン[14151  
 7-21-7]+TX、オリザストロピン[248593-16-0]+TX、ピコキシ  
 ストロピン[117428-22-5]+TX、ピラクロストロピン[175013-1  
 8-0]+TX、フェルバム[14484-64-1]+TX、マンコゼブ[8018-  
 01-7]+TX、マンネブ[12427-38-2]+TX、メチラム[9006-4  
 2-2]+TX、プロピネブ[12071-83-9]+TX、チラム[137-26-  
 8]+TX、ジネブ[12122-67-7]+TX、ジラム[137-30-4]+T  
 X、  
 【0304】  
 カプタホール[2425-06-1]+TX、キャプタン[133-06-2]+TX、  
 ジクロフルアニド[1085-98-9]+TX、フルオロイミド[41205-21-  
 4]+TX、ホルペット[133-07-3]+TX、トリルフルアニド[731-27  
 -1]+TX、ボルドー液[8011-63-0]+TX、水酸化銅(II)[2042  
 7-59-2]+TX、塩化銅[1332-40-7]+TX、硫酸銅[7758-98  
 -7]+TX、酸化銅(II)[1317-39-1]+TX、マンカップー[5398  
 8-93-5]+TX、オキシシン銅[10380-28-6]+TX、ジノカップ[13  
 1-72-6]+TX、ニトロタルイソプロピル[10552-74-6]+TX、エデ  
 ィフェンホス[17109-49-8]+TX、イブロベンホス[26087-47-8  
 ]+TX、イソプロチオラン[50512-35-1]+TX、ホスジフェン[3651  
 9-00-3]+TX、ピラゾホス[13457-18-6]+TX、トルコホスメチル  
 [57018-04-9]+TX、アシベンゾラル-S-メチル[135158-54-  
 2]+TX、アニラジン[101-05-3]+TX、ベンチアパリカルブ[41361  
 5-35-7]+TX、ブラストサイジン-S[2079-00-7]+TX、チノメチ  
 オナート[2439-01-2]+TX、クロロネブ[2675-77-6]+TX、ク  
 ロロタロニル[1897-45-6]+TX、シフルフェナミド[180409-60-  
 3]+TX、シモキサニル[57966-95-7]+TX、ジクロン[117-80-  
 6]+TX、ジクロシメット[139920-32-4]+TX、ジクロメジン[628  
 65-36-5]+TX、ジクロラン[99-30-9]+TX、ジエトフェンカルブ[  
 87130-20-9]+TX、ジメトモルフ[110488-70-5]+TX、SY  
 P-LI90(フルモルフ)[211867-47-9]+TX、ジチアノン[3347  
 -22-6]+TX、エタボキサム[162650-77-3]+TX、エトリジアゾー  
 ル[2593-15-9]+TX、ファモキサドン[131807-57-3]+TX、  
 フェアマidon[161326-34-7]+TX、フェノキサニル[115852-4  
 8-7]+TX、フェンチン[668-34-8]+TX、フェリムゾン[89269-  
 64-7]+TX、フルアジナム[79622-59-6]+TX、フルオピコリド[2  
 39110-15-7]+TX、フルスルファミド[106917-52-6]+TX、  
 フェンヘキサミド[126833-17-8]+TX、ホセチルアルミニウム[3914

10

20

30

40

50

8 - 24 - 8 ] + TX、ヒメキサゾール [ 10004 - 44 - 1 ] + TX、イプロバリカルブ [ 140923 - 17 - 7 ] + TX、IKF - 916 (シアゾファミド) [ 120116 - 88 - 3 ] + TX、カスガマイシン [ 6980 - 18 - 3 ] + TX、メタスルホカルブ [ 66952 - 49 - 6 ] + TX、メトラフェノン [ 220899 - 03 - 6 ] + TX、ベンシクロン [ 66063 - 05 - 6 ] + TX、フタリド [ 27355 - 22 - 2 ] + TX、ポリオキシシン [ 11113 - 80 - 7 ] + TX、プロベナゾール [ 27605 - 76 - 1 ] + TX、プロパモカルブ [ 25606 - 41 - 1 ] + TX、プロキナジド [ 189278 - 12 - 4 ] + TX、ピロキロン [ 57369 - 32 - 1 ] + TX、キノキシフェン [ 124495 - 18 - 7 ] + TX、キントゼン [ 82 - 68 - 8 ] + TX、スルフル [ 7704 - 34 - 9 ] + TX、チアジニル [ 223580 - 51 - 6 ] + TX、トリアゾキシド [ 72459 - 58 - 6 ] + TX、トリシクラゾール [ 41814 - 78 - 2 ] + TX、トリホリン [ 26644 - 46 - 2 ] + TX、バリダマイシン [ 37248 - 47 - 8 ] + TX、ゾキサミド (RH7281) [ 156052 - 68 - 5 ] + TX、マンジプロパミド [ 374726 - 62 - 2 ] + TX、イソピラザム [ 881685 - 58 - 1 ] + TX、セダキササン [ 874967 - 67 - 6 ] + TX、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1H - 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 - メタノンナフタレン - 5 - イル) - アミド (国際公開第2007/048556号パンフレットに開示されている) + TX、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (3', 4', 5' - トリフルオロ - 2 - ビフェニル - 2 - イル) - アミド (国際公開第2006/087343号パンフレットに開示されている) + TX、[ (3S, 4R, 4aR, 6S, 6aS, 12R, 12aS, 12bS) - 3 - [ (シクロプロピルカルボニル) オキシ ] - 1, 3, 4, 4a, 5, 6, 6a, 12, 12a, 12b - デカヒドロ - 6, 12 - ジヒドロキシ - 4, 6a, 12b - トリメチル - 11 - オキソ - 9 - (3 - ピリジニル) - 2H, 11H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 [ 915972 - 17 - 7 ] + TXおよび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 ] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド [ 926914 - 55 - 8 ] + TX。

#### 【0305】

例えば [ 3878 - 19 - 1 ] といった有効成分に続く括弧中の参照は、Chemical Abstracts Registry numberを指している。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) 1995 - 2004]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。

#### 【0306】

上記明細書において、上記の活性成分の大部分は、いわゆる「慣用名」、関連する「ISO慣用名」または他の「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/Chemical

10

20

30

40

50

cal Abstracts名、「化学名」、「慣習名」、「化合物名」もしくは「開発コード」が用いられており、または、これらの呼称もしくは「慣用名」のいずれも用いられていない場合には、「代替名」が採用されている。「CAS登録番号」とは、Chemical Abstracts Registry Numberを意味する。

【0307】

表A1～A27、B1～B12、C1～C12およびD1～D5（上記）から選択される式Iの化合物と、上記の活性成分との活性成分混合物は、表A1～A27、B1～B12、C1～C12およびD1～D5（上記）から選択される化合物と、上記の活性成分とを、100：1～1：6000、特に50：1～1：50、特に20：1～1：20の比、特に10：1～1：10、特に5：1～1：5の混合比で含んでいることが好ましく、2：1～1：2の比が特に好ましく、および、4：1～2：1の比が同様に好ましく、とりわけ、1：1、または、5：1、または、5：2、または、5：3、または、5：4、または、4：1、または、4：2、または、4：3、または、3：1、または、3：2、または、2：1、または、1：5、または、2：5、または、3：5、または、4：5、または、1：4、または、2：4、または、3：4、または、1：3、または、2：3、または、1：2、または、1：600、または、1：300、または、1：150、または、1：35、または、2：35、または、4：35、または、1：75、または、2：75、または、4：75、または、1：6000、または、1：3000、または、1：1500、または、1：350、または、2：350、または、4：350、または、1：750、または、2：750、または、4：750の比が好ましい。これらの混合比は、重量比である。

10

20

【0308】

上記の混合物は、上記の混合物を含む組成物を有害生物もしくはその環境に適用するステップを含む有害生物を防除する方法において用いられることが可能であるが、手術もしくは治療によるヒトもしくは動物の身体の処置法、および、ヒトまたは動物の身体において実施される診断法は除かれる。

【0309】

表A1～A27、B1～B12、C1～C12およびD1～D5（上記）から選択される式Iの化合物と、上記の1種以上の活性成分とを含む混合物は、例えば、単一の「調合済み」形態で、単一の活性成分コンポーネントの個々の配合物から組成される「タンク混合物」などの複合型噴霧混合物で、および、逐次的（すなわち、数時間また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活性成分を併用して適用されることが可能である。表A1～A27、B1～B10およびC1～C12（上記）から選択される式Iの化合物と上記の活性成分を適用する順番は本発明の作用については重要ではない。

30

【0310】

本発明による組成物はまた、例えば未エポキシ化またはエポキシ化植物性油（例えばエポキシ化ココナツ油、ナタネ油またはダイズ油）といった安定化剤、例えばシリコン油といった消泡剤、防腐剤、粘度調節剤、バインダおよび/もしくは粘着剤、肥料、または、特定の効果を達成するための他の活性成分、例えば殺菌剤、殺真菌剤、抗線虫薬、植物活性化剤、殺軟体動物剤もしくは除草剤などのさらなる固体助剤もしくは液体助剤を含んでいることが可能である。

40

【0311】

本発明による組成物は、それ自体は公知である様式において、助剤の不在下で、例えば、固体活性成分を粉末化し、スクリーニングし、および/または、固体に圧縮することにより調製され、また、少なくとも1種の助剤の存在下に、例えば、活性成分を助剤と共に均質混合し、および/または、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、および、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。

【0312】

50

本発明の他の態様は、式 I の化合物もしくは上記に定義されている好ましい個別の化合物、少なくとも 1 種の式 I の化合物もしくは少なくとも 1 種の上記に定義されている好ましい個別の化合物を含む組成物、または、少なくとも 1 種の式 I の化合物もしくは少なくとも 1 種の上記に定義されている好ましい個別の化合物を含む殺真菌性もしくは殺虫性混合物であって、上記の他の殺真菌剤もしくは殺虫剤を伴う混和物における使用であり、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、または、昆虫も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もしくは予防するための使用に関する。

【 0 3 1 3 】

10

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、または、昆虫、もしくは、特に真菌性生物といった植物病原性もしくはヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物もしくは生物による非生体材料に係る外寄生を防除もしくは予防する方法に関し、この方法は、式 I の化合物もしくは上記に定義されている好ましい個別の化合物を、活性成分として植物、植物の一部もしくはその生息地、その繁殖体、または、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。

【 0 3 1 4 】

防除もしくは予防とは、昆虫による、または、特に真菌性生物といった植物病原性もしくはヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物もしくは生物による外寄生を、向上が

20

実証されるレベルまで低減させることを意味する。

【 0 3 1 5 】

特に真菌性生物といった植物病原性微生物または昆虫による作物植物の外寄生を防除もしくは予防する好ましい方法であって、式 I の化合物また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。適用頻度および適用量は、対応する病原体また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、または、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、種子または塊茎を殺真菌剤の液体配合物に含浸させることにより、または、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。

30

【 0 3 1 6 】

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または液体補助剤また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、固体キャリアおよ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、および/または、粉碎することにより調製され得る。

【 0 3 1 7 】

流行している状況における意図される目的、および、上述の種類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、拡散または流しかけなどの上述の種類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 ~ 1000 ppm、好ましくは 0.1 ~ 500 ppm の活性成分である。1ヘクタール当たりの適用量は、好ましくは 1 g ~ 2000 g の活性成分 / ヘクタール、より好ましくは 10 ~ 1000 g / ha、最も好ましくは 10 ~ 600 g / 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、1 kg の種子に対して 10 mg ~ 1 g の活性物質である。

40

【 0 3 1 8 】

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

50

般に十分とされる。

【0319】

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、または、病害の発生後を意味する治療的に適用される。

【0320】

本発明の組成物は、いずれかの従来の形態、例えば、二液系、乾燥種子処理用粉末(DS)、種子処理用エマルジョン(ES)、種子処理用流動性濃縮物(FS)、種子処理用溶液(LS)、種子処理用水分散性粉末(WS)、種子処理用カプセル懸濁液(CF)、種子処理用ゲル(GF)、エマルジョン濃縮物(EC)、懸濁液濃縮物(SC)、サスポエマルジョン(SE)、カプセル懸濁液(CS)、水分散性顆粒(WG)、乳化性顆粒(EG)、エマルジョン、油中水型(EO)、エマルジョン、水中油型(EW)、マイクロエマルジョン(ME)、油分散体(OD)、油混和性の流動体(OF)、混油性液体(OL)、可溶性濃縮物(SL)、超低体積懸濁液(SU)、超低体積液体(UL)、工業用濃縮物(TK)、分散性濃縮物(DC)、水和剤(WP)、または、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。

【0321】

このような組成物は、従来の様式で、例えば活性成分を、適切な不活性配合物(希釈剤、溶剤、充填材、ならびに、界面活性剤、殺生剤、不凍剤、展着剤、増粘剤およ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EC、SC、DC、OD、SE、EW、EO等)、水和剤およ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、およびエトキシ化アルキルフェノールおよびエトキシ化脂肪族アルコールといった、湿潤剤および分散剤およ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。

【0322】

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、例えば水性懸濁液また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およ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、単一種の活性成分を含有していても、または、例えば緩効性カプセルもしくはマイクロカプセルとしてカプセル化形態で活性成分の組み合わせを含有していてもよい。

【0323】

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、ならびに、10~99.99%の固体または液体不活性配合物および補助剤を含み、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)および(C)、および、任意により他の活性薬剤、特に殺菌剤また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。

【0324】

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】

【0325】

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、3

10

20

30

40

50

ppm、1.5 ppm、0.8 ppmまたは0.2 ppm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。

【0326】

本記載を通じて、温度は摂氏度で示されており、「m.p.」は融点を意味する。LC/MSは液体クロマトグラフィ質量分析を意味し、用いた装置および方法の説明は以下のとおりである。

【0327】

方法G:

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

10

20

【0328】

方法H:

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

30

【0329】

配合物実施例

【0330】

水和剤

活性成分[式(I)の化合物]

リグノスルホン酸ナトリウム

ラウリル硫酸ナトリウム

ナトリウムジイソブチルナフタレンスルホネート

フェノールポリエチレングリコールエーテル

(7~8 molのエチレンオキシド)

高分散ケイ酸

カオリン

	a)	b)	c)
活性成分[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	—	2 %	—
(7~8 molのエチレンオキシド)			
高分散ケイ酸	5 %	10 %	10 %
カオリン	62 %	27 %	—

40

【0331】

活性成分を補助剤と十分に混合すると共に混合物を好適なミルで十分に粉碎して、水で

50

希釈された所望の濃度の懸濁液をもたらすことが可能である水和剤を得た。

【0332】

乾燥種子処理に係る粉末	a)	b)	c)
活性成分[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

10

【0333】

活性成分を補助剤と十分に混合すると共に混合物を好適なミルで十分に粉碎して、種子処理に直接用いることが可能である粉末を得た。

【0334】

乳化性濃縮物

活性成分[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 (4~5 molのエチレンオキシド)	3 %	
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(35 molのエチレンオキシド)	4 %	20
シクロヘキサノン	30 %	
キシレン混合物	50 %	

【0335】

植物の保護において用いられることが可能である、任意の必要とされる希釈率のエマルジョンを、この濃縮物から水による希釈で得ることが可能である。

【0336】

粉剤	a)	b)	c)
活性成分[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%

30

【0337】

すぐに使用可能な粉剤は、活性成分とキャリアとを混合し、この混合物を好適なミルで粉碎することにより得られる。このような粉末は、種子の乾燥粉衣に用いられることも可能である。

40

【0338】

押し出し顆粒

活性成分[式(I)の化合物]	15 %
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 %

【0339】

活性成分を補助剤と混合および粉碎し、この混合物を水で湿らせる。この混合物を押し出し、次いで、空気流中で乾燥させる。

【0340】

50

コーティングされた顆粒

活性成分 [ 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 %
カオリン	8 9 %

【 0 3 4 1 】

細かく粉碎した活性成分を、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均一に適用する。粉末を発生しないコーティングされた顆粒がこのようにして得られる。

【 0 3 4 2 】

懸濁液濃縮物

10

活性成分 [ 式 ( I ) の化合物 ]	4 0 %
プロピレングリコール	1 0 %
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 %
リグノスルホン酸ナトリウム	1 0 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
シリコーン油 ( 7 5 % 水中エマルジョンの形態 )	1 %
水	3 2 %

【 0 3 4 3 】

細かく粉碎した活性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、または、浸漬により、微生物による外寄生から、生存している植物ならびに植物繁殖体を処理および保護可能である。

20

【 0 3 4 4 】

種子処理に係る流動性濃縮物

活性成分 [ 式 ( I ) の化合物 ]	4 0 %
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 %
1 0 ~ 2 0 モルの E O を伴うトリスチレンフェノール	2 %
1 , 2 - ベンズイソチアゾリン - 3 - オン ( 2 0 % 水溶液の形態 )	0 . 5 %
モノアゾ - 顔料カルシウム塩	5 %
シリコーン油 ( 7 5 % 水中エマルジョンの形態 )	0 . 2 %
水	4 5 . 3 %

30

【 0 3 4 5 】

細かく粉碎した活性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、または、浸漬により、微生物による外寄生から、生存している植物ならびに植物繁殖体を処理および保護可能である。

【 0 3 4 6 】

緩効性カプセル懸濁液

40

2 8 部の組み合わせた式 I の化合物を、2 部の芳香族溶剤および 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 . 0 5 部の脱泡剤および 5 1 . 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 3 4 7 】

得られるカプセル懸濁液を、0 . 2 5 部の増粘剤および 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、2 8 % の活性成分を含有する。中程度のカプセル径は 8 ~ 1 5 ミクロンである。

50

## 【0348】

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。

## 【0349】

## 調製例

実施例1：この実施例は、5-プロモ-1-イミダゾ(1,2-a)ピリミジン-6-イル-3,3-ジメチル-4H-イソキノリンの調製を例示する

ステップ1：イミダゾ(1,2-a)ピリミジン-6-カルボニトリル

0.36g(2.17mmol)の3,3-ジメトキシ-2-ホルミル-プロピオニトリルナトリウム塩の3mlのメタノール中の溶液に、0.18mlの濃塩化水素を添加した。7mlのメタノール中の0.13g(1.20mmol)の2-アミノイミダゾール硫酸塩を滴下した後、この混合物を4時間環流した。次いで、追加の0.6mlのメタノール中の0.5mlの濃塩化水素を添加し、環流を一晩継続した。この反応混合物を水中に注ぎ入れ、pH6になるまで水酸化ナトリウムを添加した。水性相をジクロロメタンで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮してイミダゾ(1,2-a)ピリミジン-6-カルボニトリルをオレンジ色の粉末として得、これをさらに精製せずに用いた。

10

## 【0350】

ステップ2：5-プロモ-1-イミダゾ(1,2-a)ピリミジン-6-イル-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン

0.40g(1.67mmol)のイミダゾ(1,2-a)ピリミジン-6-カルボニトリルの3.6mlの濃硫酸中の冷却した溶液(0)に、0.38g(1.67mmol)の1-(2-プロモフェニル)-2-メチル-プロパン-2-オールを10分間以内に添加した。また、この混合物をこの温度で1.5時間攪拌した。この反応混合物を氷水中に注ぎ入れ、水酸化ナトリウムを用いてpHを10に調節した。水性相をジクロロメタンで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮してオレンジ色の油を得、これをフラッシュクロマトグラフィ(酢酸エチル中の0~5%エタノール)により精製して5-プロモ-1-イミダゾ(1,2-a)ピリミジン-6-イル-3,3-ジメチル-4H-イソキノリンをフォームとして得た。<sup>1</sup>H NMR(400MHz, CDCl<sub>3</sub>): (ppm) = 1.30(6H, s), 2.92(2H, s), 7.15~7.25(2H, m), 7.59(1H, s), 7.69(1H, d), 7.88(1H, s), 8.68(1H, d), 8.75(1H, d)。

20

30

## 【0351】

実施例2：この実施例は、5-プロモ-3,3-ジメチル-1-ピラゾロ(1,5-a)ピリミジン-6-イル-4H-イソキノリンの調製を例示する

0.50g(3.47mmol)のピラゾロ(1,5-a)ピリミジン-6-カルボニトリルの7.6mlの濃硫酸中の冷却した溶液(0)に、0.79g(3.47mmol)の1-(2-プロモフェニル)-2-メチル-プロパン-2-オールを10分間以内に添加した。また、この混合物をこの温度で1.5時間攪拌した。この反応混合物を氷水中に注ぎ入れ、水酸化ナトリウムを用いてpHを9に調節した。水性相を酢酸エチルで抽出し、組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮してオレンジ色の固体を得、これをフラッシュクロマトグラフィ(ヘプタン/tert-ブチルメチルエーテル=2:1)により精製して、5-プロモ-3,3-ジメチル-1-ピラゾロ(1,5-a)ピリミジン-6-イル-4H-イソキノリンを黄色がかった油として得た。<sup>1</sup>H NMR(400MHz, CDCl<sub>3</sub>): (ppm) = 1.31(6H, s), 2.92(2H, s), 6.72(1H, s), 7.18(1H, t), 7.28(1H, d), 7.69(1H, d), 8.18(1H, s), 8.70(1H, s), 8.90(1H, s)。

40

## 【0352】

実施例3：この実施例は、5-プロモ-1-(3-フルオロピラゾロ(1,5-a)ピリミジン-6-イル)-3,3-ジメチル-4H-イソキノリンの調製を例示する

0.22g(0.62mmol)の5-プロモ-3,3-ジメチル-1-ピラゾロ(1

50

、5 - a) ピリミジン - 6 - イル - 4 H - イソキノリンの3 mlのアセトニトリル中の溶液に、0.28 g (1.86 mmol)の二フッ化銀を添加し、この混合物を室温で1時間攪拌した。この反応混合物を水中に注ぎ入れ、水性相を酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して茶色の油を得、これをフラッシュクロマトグラフィ(トルエン/酢酸エチル = 10 : 1)により精製して、5 - プロモ - 1 - (3 - フルオロピラゾロ(1, 5 - a)ピリミジン - 6 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 4 H - イソキノリンを茶色の油として得た。<sup>1</sup>H - NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): (ppm) = 1.29 (6H, s), 2.92 (2H, s), 7.20 (1H, t), 7.26 (1H, d), 7.70 (1H, d), 8.09 (1H, s), 8.68 (1H, s), 8.77 (1H, s)。

10

## 【0353】

実施例4: この実施例は、5 - フルオロ - 3, 3, 4, 4 - テトラメチル - 1 - ピラゾロ [1, 5 - a]ピリミジン - 6 - イル - 3, 4 - ジヒドロ - イソキノリンの調製を例示する

ピラゾロ [1, 5 - a]ピリミジン - 6 - カルボニトリル (0.35 mmol, 0.059 g)の硫酸(98% w/w, 0.76 mL, 0.46 mol/L)中の冷却した溶液(0)に、3 - (2 - フルオロフェニル) - 2, 3 - ジメチル - ブタン - 2 - オール(1.0当量, 0.35 mmol, 0.068 g)を25分間かけて少量ずつ添加した。次いで、この反応混合物を氷水混合物中にゆっくりと注ぎ入れ、NaOH水溶液(2 mol/L)を用いてpHを9に調節した。水性相をDCMで抽出し、組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して100 mgのオレンジ色の残渣を得、これをフラッシュクロマトグラフィ(0 ~ 50%のシクロヘキサン中のEtOAc)により精製して、5 - フルオロ - 3, 3, 4, 4 - テトラメチル - 1 - ピラゾロ [1, 5 - a]ピリミジン - 6 - イル - 3, 4 - ジヒドロ - イソキノリン(0.093 mmol, 30 mg, 27%収率)を白色の固体として得た。<sup>1</sup>H - NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): (ppm) = 1.32 (6H, s), 1.46 (6H, d, J = 2.57 Hz), 6.79 (1H, dd, J = 2.38, 0.92 Hz), 7.12 (1H, dd, J = 7.34, 1.47 Hz), 7.17 ~ 7.34 (3H, m), 8.22 (1H, d, J = 2.20 Hz), 8.71 (1H, d, J = 2.20 Hz), 8.92 (1H, d, J = 1.47 Hz); <sup>19</sup>F - NMR (377 MHz, CDCl<sub>3</sub>): (ppm) = -109.72 (1F, br. s.); LC - MS, UV検出: 220 nm; Rt = 1.33, MS: (M + 1) = 323.4

20

30

## 【0354】

実施例5: この実施例は、5 - フルオロ - 3, 3, 4, 4 - テトラメチル - 1 - ピロロ [1, 2 - a]ピリミジン - 3 - イル - イソキノリンの調製を例示する

ステップ1: 5 - クロロ - 2 - プロブ - 1 - イニル - ピリミジンの調製。

2, 5 - ジクロロピリミジン(20.4 mmol, 3.10 g)のジオキサン(1 M, 20 mL)中の溶液に、室温で、トリブチル(1 - プロピニル)錫(1.1当量, 22.4 mmol, 7.1 mL)、続いて、ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)ジクロリド(2.04 mmol, 0.1当量, 1.45 g)を添加した。この反応混合物を脱気し、次いで、80 で一晩攪拌した。この反応混合物をNaOH(0.50 M)およびNaHCO<sub>3</sub>溶液で失活させ、1時間激しく攪拌した。混合物をジクロロメタンで抽出し、組み合わせた有機相をNaOHおよび塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、5 - クロロ - 2 - プロブ - 1 - イニル - ピリミジン(2.74 g, 88%収率)をオレンジ色の固体として得た: LC - MS (方法G), Rt = 0.68; MS: (M + 1) = 153 ~ 155。

40

## 【0355】

ステップ2: 3 - クロロピロロ(1, 2 - a)ピリミジンの調製。

5 - クロロ - 2 - プロブ - 1 - イニル - ピリミジン(9.83 mmol, 1.50 g)のジメチルアセタミド(0.30 M, 30 mL)およびトリエチルアミン(7当量, 68

50

. 8 mmol、9.6 mL)中の溶液を脱気した。次いで、塩化銅(2.0当量、19.7 mmol、2.01 g)を室温で添加し、反応混合物を140 で4時間撹拌した。この反応混合物を酢酸エチルで希釈し、飽和NH<sub>4</sub>Cl水溶液、水および塩水で洗浄した。有機相を分離し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、3-クロロピロロ(1,2-a)ピリミジン(248 mg、17%収率)を黄色の固体として得た：LC-MS(方法G), Rt = 0.75, MS : (M + 1) = 153 ~ 155。

【0356】

ステップ3：ピロロ(1,2-a)ピリミジン-3-カルボニトリルの調製。

3-クロロピロロ(1,2-a)ピリミジン(1.61 mmol、0.250 g)のDMF(0.20 M、8.0 mL)中の溶液に、シアン化亜鉛(4.0当量、6.42 mmol、0.754 g)およびパラジウムテトラキス(トリフェニルホスフィン)(0.20当量、0.321 mmol、0.371 g)を添加した。この反応混合物にマイクロ波を190 で30分間照射した。この反応混合物を酢酸エチルで希釈し、飽和NaHCO<sub>3</sub>水溶液、水および塩水で洗浄した。有機相を回収し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、ピロロ(1,2-a)ピリミジン-3-カルボニトリル(120 mg、52%収率)を黄色の固体として得た：融点：165 ~ 167 ; LC-MS(方法G), Rt = 0.56, MS : (M + 1) = 144。

【0357】

ステップ4：5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-1-ピロロ[1,2-a]ピリミジン-3-イル-イソキノリンの調製。

ピロロ(1,2-a)ピリミジン-3-カルボニトリル(0.75 mmol、0.107 g)および3-(2-フルオロフェニル)-2,3-ジメチル-ブタン-2-オール(3.0当量、2.24 mmol、0.44 g)のジクロロエタン(0.20 M、3.7 mL)中の溶液に、トリフリック酸(20当量、15 mmol、1.35 mL)を0~5で滴下した。この反応混合物を0 で3時間撹拌し、次いで、ジクロロメタン(50 mL)で希釈し、飽和NaHCO<sub>3</sub>水溶液で失活させた。水性相をジクロロメタンによりpH = 8~9で抽出した。組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-1-ピロロ[1,2-a]ピリミジン-3-イル-イソキノリン(89 mg、33%収率)をガムとして得た：LC-MS(方法G), Rt = 0.81, MS : (M + 1) = 322。

【0358】

実施例6：この実施例は、6-(4,4,5-トリフルオロ-3,3-ジメチル-1-イソキノリル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボニトリルの調製を例示する  
ステップ1：3-ブロモピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-6-カルボニトリルの調製  
ナトリウム(E)-2-シアノ-3,3-ジメトキシ-プロブ-1-エン-1-オレート(11.1 mmol、1.83 g)のメタノール(0.20 M、30 mL)中の溶液に、室温で、HClを添加し(12 M、6.8当量、42.0 mmol、3.5 mL)、続いて、メタノール(0.20 M、30 mL)中の4-ブロモ-1H-ピラゾール-3-アミン(6.17 mmol、1.00 g)を滴下した。この反応混合物を室温で1.5時間撹拌した。この反応混合物を減圧中で濃縮し、次いで、水を添加し、混合物をジクロロメタンで抽出した。組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥させ、ろ過し、濃縮して3-ブロモピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-6-カルボニトリル(1.38 g、95%収率)を黄色の固体として得た：融点：156 ~ 159 ; LC-MS(方法G), Rt = 0.64; MS : (M + 1) = 223 ~ 225。

【0359】

ステップ2：1-(3-ブロモピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-6-イル)-5-フルオロ-3,3-ジメチル-4H-イソキノリンの調製

3 - プロモピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリミジン - 6 - カルボニトリルの冷硫酸 ( 50 当量、212.9 mmol、12.3 mL ) 中の溶液に、1 - ( 2 - フルオロフェニル ) - 2 - メチル - プロパン - 2 - オールを 0 で滴下し、この反応混合物を 0 ~ 5 で 1.5 時間撹拌した。この反応混合物を、NaOH 水溶液 ( 1 M ) と混合した冷飽和 NaHCO<sub>3</sub> 水溶液に注意深く滴下した。混合物をジクロロメタンにより pH 8 ~ 9 で抽出した。組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、1 - ( 3 - プロモピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリミジン - 6 - イル ) - 5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 4 H - イソキノリン ( 0.51 g、32% 収率 ) を黄色の固体として得た：融点：121 ~ 123 ; LC - MS ( 方法 G ) , Rt = 1.01 ; MS : ( M + 1 ) = 373 ~ 375

10

## 【 0360 】

ステップ 3 : 4 - プロモ - 1 - ( 3 - プロモピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリミジン - 6 - イル ) - 5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 4 H - イソキノリンの調製

1 - ( 3 - プロモピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリミジン - 6 - イル ) - 5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 4 H - イソキノリン ( 1.31 mmol、0.49 g ) の CCl<sub>4</sub> ( 0.10 M、13 mL ) 中の溶液に、室温で、N - プロモスクシンイミド ( 2.1 当量、2.76 mmol、0.496 g ) および AIBN ( 0.1 当量、0.131 mmol、22 mg ) を添加し、この反応混合物を 70 で 8 時間撹拌した ( 完全な転換のために、AIBN ( 0.1 当量 ) を 3 回添加する必要があった ) 。この反応混合物を室温に冷却し、セライトパッドを通してろ過した。このパッドをジクロロメタンで洗浄した。濾液を飽和 NaHCO<sub>3</sub> 水溶液および塩水で洗浄した。これを Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で乾燥させ、ろ過し、濃縮して 4 - プロモ - 1 - ( 3 - プロモピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリミジン - 6 - イル ) - 5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 4 H - イソキノリン ( 770 mg、98% 収率 ) をオレンジ色の固体として得、これを次のステップにおいてさらに精製することなく直接用いた：LC - MS ( 方法 G ) , Rt = 1.09 ; MS : ( M + 1 ) = 453。

20

## 【 0361 】

ステップ 4 : 1 - ( 3 - プロモピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリミジン - 6 - イル ) - 5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 4 H - イソキノリン - 4 - オールの調製

4 - プロモ - 1 - ( 3 - プロモピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリミジン - 6 - イル ) - 5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 4 H - イソキノリン ( 1.36 mmol、770 mg ) の、水 ( 0.10 M、14 mL ) およびジオキサン ( 0.10 M、14 mL ) の混合物中の溶液を 80 で 2.5 時間撹拌した。この反応混合物を室温に冷まし、酢酸エチルおよび水で希釈し飽和 NaHCO<sub>3</sub> 水溶液で pH 8 ~ 9 に塩基性化した。組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で乾燥させ、ろ過し、濃縮して 1 - ( 3 - プロモピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリミジン - 6 - イル ) - 5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 4 H - イソキノリン - 4 - オール ( 620 mg、99% 収率 ) をオレンジ色のガムとして得、これを次のステップにおいてさらに精製することなく直接用いた：LC - MS ( 方法 G ) , Rt = 0.81 ; MS : ( M + 1 ) = 389 ~ 391。

30

## 【 0362 】

ステップ 5 : 1 - ( 3 - プロモピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリミジン - 6 - イル ) - 5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オンの調製

1 - ( 3 - プロモピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリミジン - 6 - イル ) - 5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 4 H - イソキノリン - 4 - オール ( 1.59 mmol、620 mg ) のジクロロメタン ( 0.08 M、20 mL ) 中の溶液に、0 ~ 5 で、1,1 - トリアセトキシ - 1,1 - ジヒドロ - 1,2 - ベンズヨードオキシオール - 3 ( 1 H ) - オン ( 1.25 当量、1.99 mmol、871 mg ) を添加し、この反応混合物を 0 ~ 室温で、3 時間撹拌した。この反応混合物をジクロロメタンで希釈し、飽和 NaHCO<sub>3</sub> 水溶液および塩水で洗浄した。有機相を Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、1 - ( 3 - プロモピラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリミジン - 6 - イル ) - 5 - フルオロ - 3 , 3 - ジメチル - イソキノリン - 4 - オン ( 360

40

50

mg、53%収率)を黄色の固体として得た：融点：201~203；LC-MS(方法G)，Rt=0.94，MS：(M+1)=387~389。

【0363】

ステップ6：1-(3-プロモピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-6-イル)-4,4,5-トリフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリンの調製

1-(3-プロモピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-6-イル)-5-フルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン-4-オン(0.929mmol、360mg)の2,2-ジフルオロ-1,3-ジメチル-イミダゾリジン(10.0当量、9.29mmol、1.2mL)中の溶液を105で一晚攪拌した。この反応混合物を室温に冷まし、次いで、飽和NaHCO<sub>3</sub>水溶液にゆっくりと添加することにより失活させた。水性相をジクロロメタンによりpH7~8で抽出し、組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、1-(3-プロモピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-6-イル)-4,4,5-トリフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン(270mg、71%収率)を白色の固体として得た：融点164~166；LC-MS(方法G)，Rt=1.08；MS：(M+1)=409~411。

10

【0364】

ステップ7：6-(4,4,5-トリフルオロ-3,3-ジメチル-1-イソキノリル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボニトリルの調製

1-(3-プロモピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-6-イル)-4,4,5-トリフルオロ-3,3-ジメチル-イソキノリン(0.269mmol、110mg)のDMF(0.1M、2.7mL)中の溶液に、シアン化亜鉛(4当量、1.075mmol、126mg)を添加した。この溶液をアルゴンで脱気し、次いで、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)(0.2当量、62.1mg)を添加し、この反応混合物にMWを170で20分間照射した。この反応混合物を酢酸エチルで希釈し、飽和NaHCO<sub>3</sub>水溶液で失活させた。水性相を酢酸エチルで抽出し、組み合わせた有機相を水および塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、6-(4,4,5-トリフルオロ-3,3-ジメチル-1-イソキノリル)ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-3-カルボニトリル(44mg、44%収率)を明るい茶色の固体として得た：融点215~217；LC-MS(方法G)，Rt=1.00；MS：(M+1)=356。

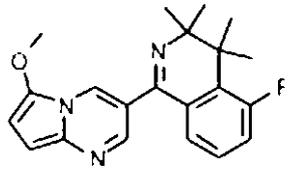
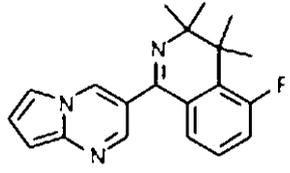
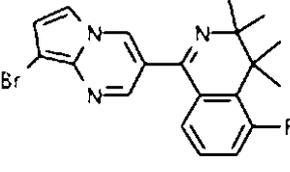
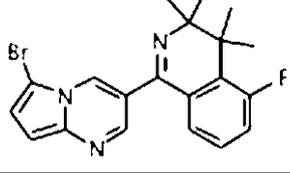
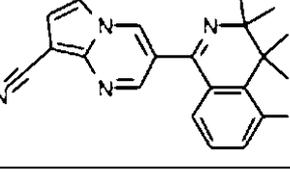
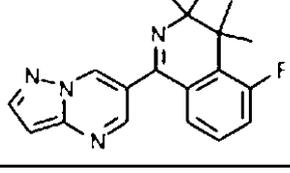
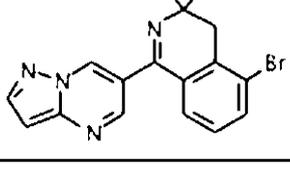
20

30

【0365】

【表 2】

表E：式 I の化合物の物理データ

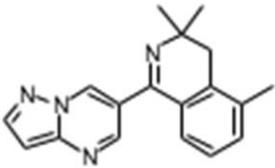
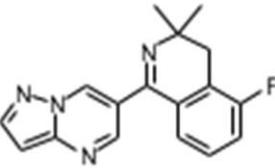
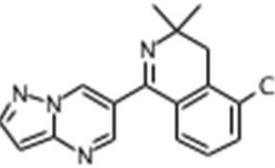
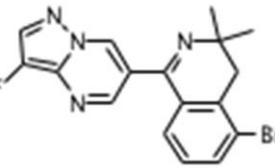
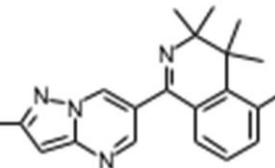
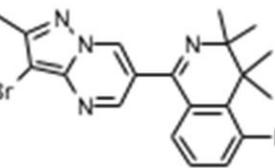
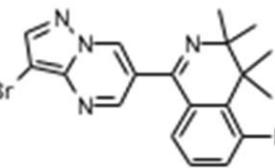
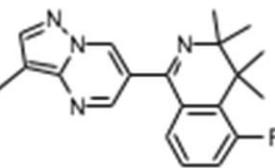
項目	構造	RT (min)	[M+H](計測値)	方法	MP °C
E 1		0.84	352	G	120 - 122
E 2		0.81	322	G	130 - 134
E 3		1.08	400-402	G	
E 4		0.96	400-402	G	166 - 167
E 5		1.01	347	G	
E 6		1.33	323	H	
E 7		0.94	357	G	

10

20

30

40

E 8		0.69	291	G	
E 9		0.81	295	G	159 - 160
E 10		0.92	311	G	105 - 105
E 11		1.03	375	G	
E 12		1.38	337	H	180 - 190
E 13		1.14	415-417	G	132 - 134
E 14		1.11	401-403	G	58 - 61
E 15		0.97	337	G	126 - 128

10

20

30

40

E 16		1.06	348	G	179 - 182
E 17		1.01	373-375	G	121 - 123
E 18		0.81	389-391	G	
E 19		0.94	387-389	G	201 - 203
E 20		1.16	394	G	112 - 114
E 21		1.08	409-411	G	164 - 166
E 22		0.97	345	G	135 - 138
E 23		1.09	362	G	176 - 178

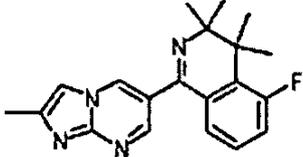
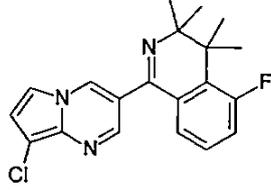
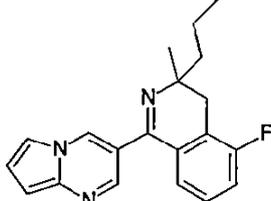
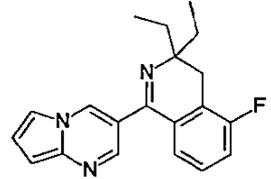
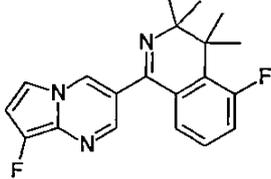
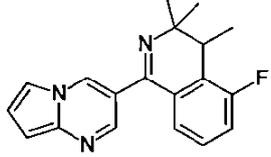
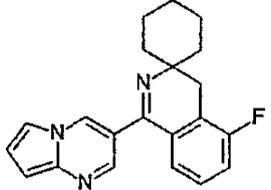
10

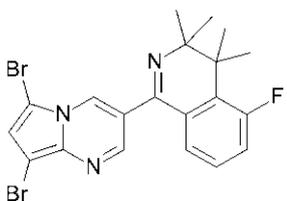
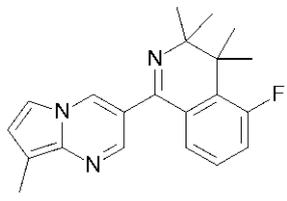
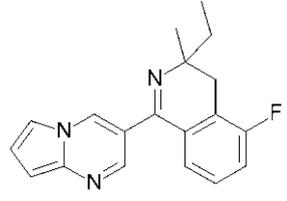
20

30

40



E 32		0.80	337	G	
E 33		0.97	356-358	G	10
E 34		0.89	322	G	
E 35		0.88	322	G	20
E 36		0.90	340	G	
E 37		0.76	308	G	30
E 38		0.94	334	G	

E 39		1.25	478-480-482	G	141-143
E 40		0.85	336	G	
E 41		0.80	308	G	

## 【 0 3 6 6 】

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*)) / 液体培地 (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 (Vogels 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。

## 【 0 3 6 7 】

表 E からの以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生を示した未処理の対照葉片と比した場合に、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、E 2、E 3、E 4、E 6、E 7、E 8、E 9、E 10、E 11、E 12、E 13、E 14、E 15、E 16、E 17、E 20、E 21、E 22、E 23、E 24、E 25、E 26、E 31、E 32。

## 【 0 3 6 8 】

グロメララゲナリウム (*Glomerella lagenarium*) (コレトトリカムラゲナリウム (*Colletotrichum lagenarium*)) / 液体培地 (炭疽病)

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計測する。

E 1、E 2、E 3、E 4、E 6、E 7、E 8、E 9、E 10、E 11、E 12、E 13、E 14、E 15、E 16、E 17、E 20、E 21、E 22、E 23、E 24、E 25、E 26、E 27、E 29、E 31、E 32。

## 【 0 3 6 9 】

フザリウムクルモルム (*Fusarium culmorum*) / 液体培地 (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

10

20

30

40

50

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。

【0370】

表 E からの以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生を示した未処理の対照葉片と比した場合に、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、E 2、E 3、E 4、E 15、E 23、E 25。

【0371】

ゲーウmanoミセスグラミニス (*Gaeumannomyces graminis*) / 液体培地 (穀類の立枯病)

極低温保管しておいた真菌の菌糸体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、成長の障害を測光法により測定する。

【0372】

表 E からの以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生を示した未処理の対照葉片と比した場合に、20 ppm でゲーウmano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 7、E 11。

【0373】

モノグラフェラニバリス (*Monographella nivalis*) (コムギ赤かび病菌 (*Microdochium nivale*)) / 液体培地 (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、成長の障害を測光法により測定する。

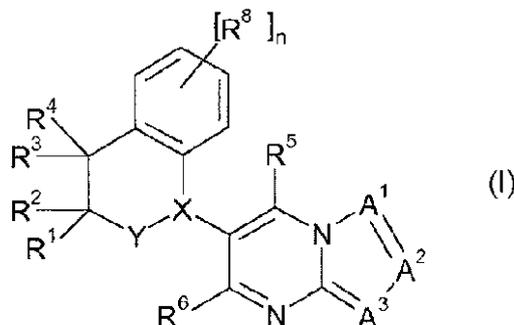
【0374】

表 E からの以下の化合物が、同一の条件下において、大幅な病害の発生を示した未処理の対照葉片と比した場合に、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、E 2、E 3、E 4、E 7、E 11、E 14、E 15、E 22。

本発明のまた別の態様は、以下のとおりであってもよい。

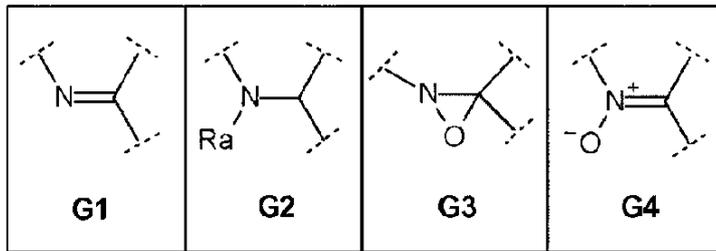
〔1〕式 I の化合物



(式中、

A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>およびA<sup>3</sup>の各々は、独立して、窒素原子またはC R<sup>7</sup>を表し；

Y - Xは、G 1、G 2、G 3およびG 4から選択される基を表し；



$R^1$ および $R^2$ は各々、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルから独立して選択され、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオおよびフェノキシ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；または

10

$R^1$ および $R^2$ は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル基（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよびフェノキシからなる群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）を表し；

$R^3$ および $R^4$ は各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルから独立して選択され、ここで、前記アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオおよびフェノキシ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；または

20

$R^3$ および $R^4$ は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ 、 $C=CH_2$ または $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよびフェノキシからなる群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）を表し；

$R^5$ は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシまたはヒドロキシルであり；

$R^6$ は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシまたはヒドロキシルであり；

各 $R^7$ は独立して、水素、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルまたはヒドロキシルを表し；

30

各 $R^8$ は独立して、ヒドロキシル、ハロゲン、シアノ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、 $CO_2H$ 、 $CO_2(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $C(O)N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、 $C(O)NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $C(O)NH_2$ 、 $NH(C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル)、 $N(C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル) $_2$ 、アリーール、ヘテロアリーール、アリーールオキシまたはヘテロアリーールオキシを表し、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルおよびフェノキシからなる群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、ならびに、前記アリーールまたはヘテロアリーール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル（これ自体、1～3個のハロゲン原子で置換されていてもよい）、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、アミノ（これ自体、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルから独立して選択される1個または2個の基で置換されていてもよい）、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、メルカプトおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～5個の置換基で置換されていてもよく； $n$ は0、1、2、3または4であり；

40

$R^a$ は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、これは、

50

ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオおよびフェノキシからなる群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)

または、その塩もしくはN-オキシド。

[2]  $A_1$ 、 $A_2$ および $A_3$ の1つ以上が $CR^7$ を表す、前記[1]に記載の化合物。

[3] 各 $R^7$ が独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルまたはヒドロキシルを表す、前記[1]または[2]に記載の化合物。

[4] Y-Xが、G1、G2またはG4である、前記[1]、[2]または[3]のいずれか一項に記載の化合物。

[5]  $R^1$ および $R^2$ が各々、水素、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、前記アルキルおよびシクロアルキル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ 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；または、 $R^1$ および $R^2$ が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基を表す、前記[1]、[2]、[3]または[4]のいずれか一項に記載の化合物。

[6]  $R^3$ および $R^4$ が各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択され、ここで、前記アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ 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；または、 $R^3$ および $R^4$ が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ または $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル(これは、ハロゲン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)を表す、前記[1]、[2]、[3]、[4]または5のいずれか一項に記載の化合物。

[7]  $R^5$ が、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである、前記[1]、[2]、[3]、[4]、5または6のいずれか一項に記載の化合物。

[8]  $R^6$ が、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである、前記[1]、[2]、[3]、[4]、5、6または7のいずれか一項に記載の化合物。

[9] 各 $R^8$ が独立して、ヒドロキシル、ハロゲン、シアノ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、フェニル、ヘテロアリール(ここで、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである)、フェノキシまたはヘテロアリールオキシ(ここで、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである)を表し、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ヒドロキシルからなる群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、ならびに、前記フェニル、フェノキシおよびヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル(これ自体、1～3個のハロゲン原子で置換されてもいてもよい)または $C_1 \sim C_6$ アルコキシからなる群から独立して選択される1～5個の置換基で置換されていてもよく；nが、0、1、2、または3である、前記[1]、[2]、[3]、[4]、5、6、7または8のいずれか一項に記載の化合物。

[10] Y-XがG2である場合、 $R^a$ が水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルである、前記[1]、[2]、[3]、[4]、5、6、7、8または9のいずれか一項に記載の化合物。

[11] 前記[1]に記載の化合物であって、 $A_1$ 、 $A_2$ および $A_3$ の2つ以上が $CR^7$ を表し；各 $R^7$ が独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはヒドロキシルを表し；Y-XがG1であり； $R^1$ および $R^2$ が各々、 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され、ここで、前記アルキル基は、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_6$ アルコキシ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；または、 $R^1$ および $R^2$ が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基を表し； $R^3$ および $R^4$ が各々、水素、ハロゲン、および $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され；または、 $R^3$ および $R^4$ が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ またはシクロプロピルを表し； $R^5$ が水素またはハロゲンであり； $R^6$ が水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；各 $R^8$ が独

10

20

30

40

50

立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、フェニル、ヘテロアリール（ここで、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニルまたはチアゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリーロキシ（ここで、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニルまたはチアゾリルである）を表し、ここで、前記アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲンからなる群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、ならびに、前記フェニル、フェノキシおよびヘテロアリール基は、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_3$ アルキル（これ自体、1～3個のハロゲン原子で置換されていてもよい）からなる群から独立して選択される1個もしくは2個の置換基で置換されていてもよく；ならびに、nが、0、1または2である化合物、または、その塩もしくはN-オキsid。

〔12〕殺真菌的に有効な量の前記〔1〕～〔11〕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。

〔13〕少なくとも1種の追加の活性成分および/または希釈剤をさらに含む、前記〔12〕に記載の組成物。

〔14〕植物病原性微生物の駆除、予防または防除方法であって、植物病原体、前記植物病原体の生息地、または、植物病原体による被害を受けやすい植物、または、その繁殖体に、殺真菌的に有効な量の前記〔1〕～〔11〕のいずれかに定義されている式（I）の化合物、または、殺真菌的に有効な量の前記〔1〕～〔11〕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ことを含む、前記方法。

## フロントページの続き

(51)Int.Cl. F I  
A 0 1 N 43/90 1 0 4

- (74)代理人 100119013  
弁理士 山崎 一夫
- (74)代理人 100123777  
弁理士 市川 さつき
- (74)代理人 100111796  
弁理士 服部 博信
- (74)代理人 100162422  
弁理士 志村 将
- (72)発明者 カランタ ラウラ  
スイス ツェーハー - 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ ク  
ロップ プロテクション ミュンヒヴィーレン アーゲー内
- (72)発明者 トラー ステファン  
スイス ツェーハー - 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ ク  
ロップ プロテクション ミュンヒヴィーレン アーゲー内
- (72)発明者 ボウ ハムダン ファルハーン  
スイス ツェーハー - 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ ク  
ロップ プロテクション ミュンヒヴィーレン アーゲー内
- (72)発明者 ランバース クレメンス  
スイス ツェーハー - 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ ク  
ロップ プロテクション ミュンヒヴィーレン アーゲー内

審査官 前田 憲彦

- (56)参考文献 国際公開第2009/081579(WO, A1)  
特開2013-139427(JP, A)  
欧州特許出願公開第02517562(EP, A1)  
国際公開第2008/066148(WO, A1)  
国際公開第2007/011022(WO, A1)

- (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)  
C 0 7 D 4 8 7 / 0 0  
A 0 1 N 4 3 / 0 0  
A 0 1 P 3 / 0 0  
CAplus/REGISTRY(STN)